



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 103003263 A

(43) 申请公布日 2013. 03. 27

(21) 申请号 201180035549. 9

(51) Int. Cl.

(22) 申请日 2011. 07. 18

C07D 401/12 (2006. 01)

(30) 优先权数据

C07D 401/14 (2006. 01)

61/366, 542 2010. 07. 22 US

C07D 403/12 (2006. 01)

C07D 403/14 (2006. 01)

(85) PCT申请进入国家阶段日

C07D 407/14 (2006. 01)

2013. 01. 21

C07D 413/12 (2006. 01)

(86) PCT申请的申请数据

C07D 417/12 (2006. 01)

PCT/EP2011/062198 2011. 07. 18

C07D 417/14 (2006. 01)

(87) PCT申请的公布数据

A01N 43/60 (2006. 01)

W02012/010534 EN 2012. 01. 26

A01N 43/80 (2006. 01)

(71) 申请人 巴斯夫欧洲公司

地址 德国路德维希港

(72) 发明人 S·索格尔 C·德菲博尔

R·勒韦佐 D·L·卡伯特森

D·D·安斯帕夫

(74) 专利代理机构 北京市中咨律师事务所

11247

代理人 刘金辉 林柏楠

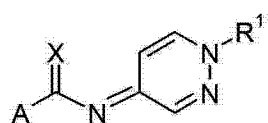
权利要求书 4 页 说明书 95 页

(54) 发明名称

防治无脊椎动物害虫的新型杂芳基(硫代)羧酰胺化合物

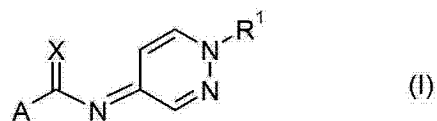
(57) 摘要

本发明涉及式(I)的杂芳基(硫代)羧酰胺化合物、其互变异构体和N-氧化物及其盐,其中X、R¹和A如说明书所定义。本发明进一步涉及一种防治无脊椎动物害虫的方法、一种保护植物繁殖材料和/或由其生长的植物的方法、包含至少一种本发明杂芳基(硫代)羧酰胺化合物的植物繁殖材料、一种处理或保护动物以防寄生虫侵染或感染的方法以及一种含有至少一种本发明化合物的农业组合物。



(I)

1. 式 I 的杂芳基(硫代)羧酰胺化合物及其盐、其 N-氧化物、其互变异构体以及所述 N-氧化物或互变异构体的盐；



其中

X 为 S 或 0:

R¹ 为 CN、C₁-C₁₀ 烷基、C₁-C₁₀ 卤代烷基、C₂-C₁₀ 链烯基、C₂-C₁₀ 卤代链

烯基、C₂-C₁₀ 炔基、C₂-C₁₀ 卤代炔基、C₁-C₅ 亚烷基 -CN、C₁-C₅ 亚烷基 -OR^a、C(Y)R^b、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)R^b、C(Y)OR^c、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)OR^c、S(O)_mR^d、C₁-C₅ 亚烷基 -NR^eR^f、C(Y)NR^eR^h、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)NR^gR^h、S(O)_mNR^eR^f、C(Y)NRⁱNR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -S(O)_mR^d、C₁-C₅ 亚烷基 -S(O)_mNR^eR^d、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)NRⁱNR^eR^f、苯基、杂环基、杂芳基、苯基 -C₁-C₅ 烷基、C₃-C₁₀ 环烷基、C₃-C₁₀ 环烷基 -C₁-C₅ 烷基、苯氧基 -C₁-C₅ 烷基、杂环基 -C₁-C₅ 烷基、杂芳基 -C₁-C₅ 烷基，其中后提到的 9 个基团的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自基团 R^y 的相同或不同取代基；

A 为具有 1 个选自 O、S、N 或 N-R^N 的杂原子结构部分作为环成员和 0、1 或 2 个另外的杂原子结构部分 N 作为环成员且还具有 2、3、4 或 5 个碳原子作为环成员的 5 或 6 员杂芳基，其中碳原子环成员可以未被取代或者 1、2、3 或 4 个碳原子环成员带有基团 R^A 作为取代基，其中

R^A 选自卤素、CN、NO₂、C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 链烯基和 C₂-C₁₀ 炔基, 其中后提到的 3 个基团可以未被取代、可以部分或完全被卤代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^X,

并且还选自 OR^a 、 $\text{C}(\text{Y})\text{R}^b$ 、 $\text{C}(\text{Y})\text{OR}^c$ 、 $\text{S}(\text{O})_m\text{R}^d$ 、 NR^eR^f 、杂环基、苯基、杂芳基、 C_3 - C_{10} 环烷基和 C_5 - C_{10} 环烯基, 其中后提到的 5 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^y ; 以及

R^N 选自氢、CN、NO₂、C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 链烯基和 C₂-C₁₀ 炔基, 其中后提到的 3 个基团可以未被取代、可以被部分或完全卤代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^X,

并且还选自 OR^a 、 $\text{C}(\text{Y})\text{R}^b$ 、 $\text{C}(\text{Y})\text{OR}^c$ 、 $\text{S}(\text{O})_{\text{m}}\text{R}^d$ 、 NR^eR^f 、 $\text{C}(\text{Y})\text{NR}^g\text{R}^h$ 、 $\text{S}(\text{O})_{\text{m}}\text{NR}^e\text{R}^f$ 、 $\text{C}(\text{Y})\text{NR}^i\text{NR}^e\text{R}^f$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_5$ 亚烷基 $-\text{OR}^a$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_5$ 亚烷基 $-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_5$ 亚烷基 $-\text{C}(\text{Y})\text{R}^b$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_5$ 亚烷基 $-\text{C}(\text{Y})\text{OR}^c$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_5$ 亚烷基 $-\text{NR}^e\text{R}^f$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_5$ 亚烷基 $-\text{C}(\text{Y})\text{NR}^g\text{R}^h$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_5$ 亚烷基 $-\text{S}(\text{O})_{\text{m}}\text{R}^d$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_5$ 亚烷基 $-\text{S}(\text{O})_{\text{m}}\text{NR}^e\text{R}^f$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_5$ 亚烷基 $-\text{NR}^i\text{NR}^e\text{R}^f$ 、杂环基、杂芳基、 $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ 环烷基、 $\text{C}_5\text{-C}_{10}$ 环烯基、杂环基 $-\text{C}_1\text{-C}_5$ 烷基、杂芳基 $-\text{C}_1\text{-C}_5$ 烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ 环烷基 $-\text{C}_1\text{-C}_5$ 烷基、 $\text{C}_5\text{-C}_{10}$ 环烯基 $-\text{C}_1\text{-C}_5$ 烷基、苯基 $-\text{C}_1\text{-C}_5$ 烷基和苯基,其中后提到的 10 个基团的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^y ;

并且其中

m 为 0、1 或 2：

Y 为 0 或 S:

R^a 、 R^b 、 R^c 相互独立地选自氢、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_3 - C_6 环烷基甲基、 C_3 - C_6 卤代环烷基、 C_2 - C_4 链烯基、 C_2 - C_4 卤代链烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基- C_1 - C_4 烷基、杂芳基- C_1 - C_4 烷基和杂环基- C_1 - C_4 烷基, 其中后提

到的 6 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的取代基；

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

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

R^e 和 R^f 与它们所键合的氮原子一起形成可以带有选自 O、S 和 N 的另外杂原子作为环成员原子的 5 或 6 员饱和或不饱和杂环，其中该杂环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的取代基；

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

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

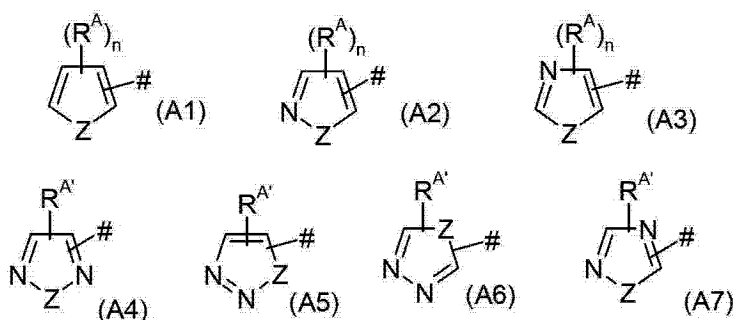
R^x 相互独立地选自氰基、硝基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 卤代烷硫基、 C_1-C_4 烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基、 C_1-C_{10} 烷基羰基、 C_3-C_6 环烷基、5-7 员杂环基、苯基、 C_3-C_6 环烷氧基、3-6 员杂环氧基和苯氧基，其中后提到的 6 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的取代基；

R^y 选自卤素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 $S(O)_m R^d$ 、 $S(O)_m NR^e R^f$ 、 C_1-C_4 烷基羰基、 C_1-C_4 卤代烷基羰基、 C_1-C_4 烷氧羰基、 C_1-C_4 卤代烷氧羰基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 卤代链烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基、 C_3-C_6 环烷基、5-7 员杂环基、杂芳基、苯基、 C_3-C_6 环烷氧基、3-6 员杂环氧基、杂芳氧基和苯氧基，其中后提到的 8 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的基团。

2. 如权利要求 1 所要求的式 I 化合物, 其中 X 为氧。

3. 如权利要求 1 或 2 所要求的式 I 化合物, 其中 R^1 选自 C_1 - C_{10} 烷基、 C_1 - C_{10} 卤代烷基、 C_3 - C_{10} 链烯基、 C_3 - C_{10} 炔基、 C_1 - C_4 亚烷基 -CN、 C_1 - C_4 亚烷基 -OR^a、苯基 - C_1 - C_4 烷基、 C_3 - C_{10} 环烷基 - C_1 - C_4 烷基、5 或 6 员饱和杂环基 - C_1 - C_4 烷基以及 5 或 6 员杂芳基 - C_1 - C_4 烷基, 其中 C_3 - C_{10} 环烷基 - C_1 - C_4 烷基和杂环基 - C_1 - C_4 烷基中的环烷基环和杂环基环分别未被取代或者带有 1、2、3、4 或 5 个, 尤其是 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^y 并且其中苯基 - C_1 - C_4 烷基和杂芳基 - C_1 - C_4 烷基中的苯基环和杂芳基环分别未被取代或者带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^y, 其中 R^a 和 R^y 如上所定义且其中 R^a 和 R^y 如权利要求 1 所定义。

4. 如权利要求 1-3 中任一项所要求的式 I 化合物, 其中 A 为具有式 A1、A2、A3、A4、A5、A6 或 A7 的 5 员杂芳基:



其中 # 表示与式 I 的剩余部分的连接点,

Z 为 O、S 或 N-R^N, 其中 R^N 如权利要求 1 所定义,

n 为 0、1、2 或 3,

R^A 如权利要求 1 所定义, 以及

R^{A'} 为氢或具有对 R^A 所给含义之一。

5. 如权利要求 4 所要求的式 I 化合物, 其中 A 为基团 A2。

6. 如权利要求 4 所要求的式 I 化合物, 其中 A 为基团 A1。

7. 如权利要求 4 所要求的式 I 化合物, 其中 A 为基团 A3。

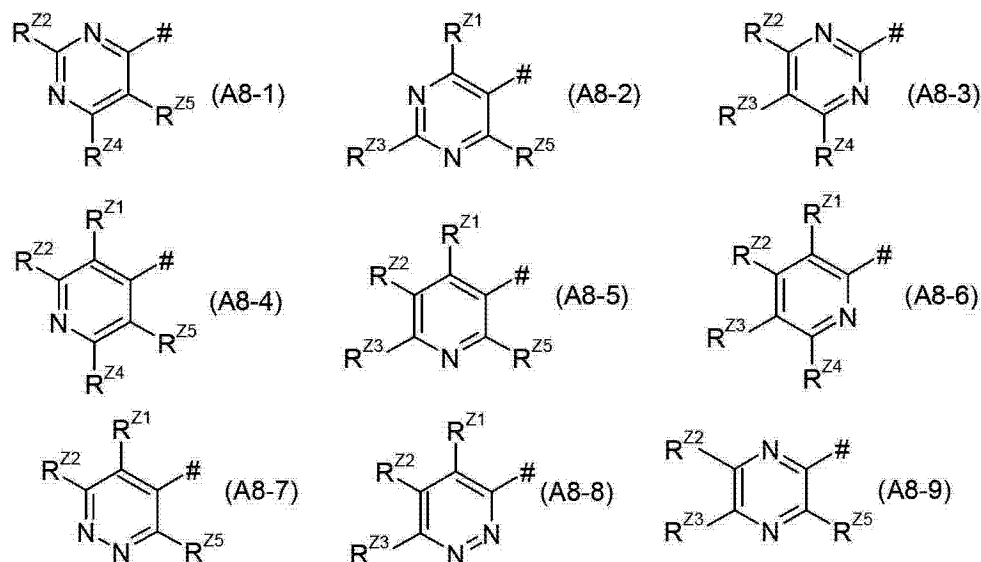
8. 如权利要求 4 所要求的式 I 化合物, 其中 A 选自基团 A4、A5、A6 和 A7。

9. 如权利要求 4-8 中任一项所要求的式 I 化合物, 其中 Z 为 NR^N, 其中 R^N 选自 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、杂环基 - C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 亚烷基 -CN、 C_3 - C_6 环烷基、 C_3 - C_6 环烷基 - C_1 - C_4 烷基, 其中后提到的 2 个基团中的环烷基结构部分未被取代或者带有 1 或 2 个选自卤素、CN 和 C_1 - C_2 卤代烷基的基团。

10. 如权利要求 9 所要求的式 I 化合物, 其中 A 为基团 A2, X 为 O 且 Z 为 NR^N, 其中 R^N 为 C_1 - C_6 烷基或 C_1 - C_6 卤代烷基。

11. 如权利要求 1-10 中任一项所要求的式 I 化合物, 其中 R^A 若存在的话则选自氢、卤素、NO₂、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基和 C_3 - C_6 卤代环烷基。

12. 如权利要求 1-3 中任一项所要求的式 I 化合物, 其中 A 选自式 A8-1、A8-2、A8-3、A8-4、A8-5、A8-6、A8-7、A8-8 和 A8-9 的基团:



其中 # 表示与式 I 的剩余部分的连接点, 以及 R^{Z1} 、 R^{Z2} 、 R^{Z3} 、 R^{Z4} 和 R^{Z5} 若存在的话则相互独立地选自氢、卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_3 亚烷基 -CN、 C_1 - C_3 亚烷基 -OR^a、 C_3 - C_7 环烷基、 C_3 - C_7 环烷基 - C_1 - C_3 烷基和 3-7 员饱和杂环基 - C_1 - C_3 烷基, 其中后提到的 3 个基团中的环烷基和杂环基可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^y 。

13. 如权利要求 12 所要求的式 I 化合物, 其中 R^{Z1} 、 R^{Z2} 、 R^{Z3} 、 R^{Z4} 和 R^{Z5} 若存在的话则相互独立地选自氢、卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基和 C_3 - C_6 卤代环烷基。

14. 一种防治无脊椎动物害虫的方法, 该方法包括用杀虫有效量的如权利要求 1-13 中任一项所定义的式 I 化合物、其互变异构体或 N-氧化物或盐处理害虫、其食物供应源、其栖息地或其繁殖地, 或者其中害虫生长或可能生长的植物、种子、土壤、区域、材料或环境, 或者要防止害虫侵袭或侵染的材料、植物、种子、土壤、表面或空间。

15. 如权利要求 1-13 中任一项所定义的式 I 化合物或其 N-氧化物或盐在防治无脊椎动物害虫中的用途。

防治无脊椎动物害虫的新型杂芳基（硫代）羧酰胺化合物

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

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

[0003] EP 78989 和 DE 3436550 描述了1-苯基吡嗪并亚胺的N-酰基酰胺。提到这些化合物可用作治疗疾病如张力亢进、帕金森氏病和抑郁的药物。

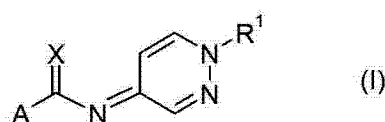
[0004] WO 2010034737 和 WO 2010034738 描述了吡唑化合物并提到了其在防除无脊椎动物害虫中的用途。

[0005] 本发明的目的是提供具有良好杀虫活性，尤其是杀昆虫活性并对大量不同的无脊椎动物害虫，尤其是难以防治的节肢动物害虫和/或线虫呈现宽活性谱的化合物。

[0006] 已经发现这些目的可以通过如下所定义的式I化合物（包括式I的任何可能立体异构体）、其盐、其互变异构体及其N-氧化物以及所述互变异构体和N-氧化物的盐，尤其是其可农用或可兽用盐实现。

[0007] 因此，本发明在第一方面涉及式I的杂芳基（硫代）羧酰胺化合物及其盐、其N-氧化物、其互变异构体以及所述N-氧化物或互变异构体的盐：

[0008]



[0009] 其中

[0010] X 为 S 或 O；

[0011] R¹ 为 CN、C₁-C₁₀ 烷基、C₁-C₁₀ 卤代烷基、C₂-C₁₀ 链烯基、C₂-C₁₀ 卤代链烯基、C₂-C₁₀ 炔基、C₂-C₁₀ 卤代炔基、C₁-C₅ 亚烷基 -CN、C₁-C₅ 亚烷基 -OR^a、C(Y)R^b、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)R^b、C(Y)OR^c、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)OR^c、S(O)_mR^d、C₁-C₅ 亚烷基 -NR^eR^f、C(Y)NR^gR^h、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)NR^gR^h、S(O)_mNR^eR^f、C(Y)NRⁱNR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -S(O)_mR^d、C₁-C₅ 亚烷基 -S(O)_mNR^eR^d、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)NRⁱNR^eR^f、苯基、杂环基、杂芳基、苯基 -C₁-C₅ 烷基、C₃-C₁₀ 环烷基、C₃-C₁₀ 环烷基 -C₁-C₅ 烷基、苯氧基 -C₁-C₅ 烷基、杂环基 -C₁-C₅ 烷基、杂芳基 -C₁-C₅ 烷基，其中后提到的 9 个基团的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自基团 R^y 的相同或不同取代基；

[0012] A 为具有 1 个选自 O、S、N 或 N-R^N 的杂原子结构部分作为环成员和 0、1 或 2 个另外的杂原子结构部分 N 作为环成员且还具有 2、3、4 或 5 个碳原子作为环成员的 5 或 6 员杂

芳基,其中碳原子环成员可以未被取代或者 1、2、3 或 4 个碳原子环成员带有基团 R^A 作为取代基,其中

[0013] R^A 选自氢、卤素、CN、NO₂、C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 链烯基和 C₂-C₁₀ 炔基,其中后提到的 3 个基团可以未被取代、可以部分或完全被卤代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^X ,

[0014] 并且还选自 OR^a、C(Y)R^b、C(Y)OR^c、S(O)_mR^d、NR^eR^f、杂环基、苯基、杂芳基、C₃-C₁₀ 环烷基和 C₅-C₁₀ 环烯基,其中后提到的 5 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^Y ; 以及

[0015] R^N 选自氢、CN、NO₂、C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 链烯基和 C₂-C₁₀ 炔基,其中后提到的 3 个基团可以未被取代、可以被部分或完全卤代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^X ,

[0016] 并且还选自 OR^a、C(Y)R^b、C(Y)OR^c、S(O)_mR^d、NR^eR^f、C(Y)NR^gR^h、S(O)_mNR^eR^f、C(Y)NRⁱNR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -OR^a、C₁-C₅ 亚烷基 -CN、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)R^b、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)OR^c、C₁-C₅ 亚烷基 -NR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)NR^gR^h、C₁-C₅ 亚烷基 -S(O)_mR^d、C₁-C₅ 亚烷基 -S(O)_mNR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -NRⁱNR^eR^f、杂环基、杂芳基、C₃-C₁₀ 环烷基、C₅-C₁₀ 环烯基、杂环基 -C₁-C₅ 烷基、杂芳基 -C₁-C₅ 烷基、C₃-C₁₀ 环烷基 -C₁-C₅ 烷基、C₅-C₁₀ 环烯基 -C₁-C₅ 烷基、苯基 -C₁-C₅ 烷基和苯基,其中后提到的 10 个基团的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^Y ;

[0017] m 为 0、1 或 2;

[0018] Y 为 O 或 S;

[0019] R^a 、 R^b 、 R^c 相互独立地选自氢、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 环烷基甲基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基 -C₁-C₄ 烷基、杂芳基 -C₁-C₄ 烷基和杂环基 -C₁-C₄ 烷基,其中后提到的 6 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的取代基;

[0020] R^d 选自 C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 环烷基甲基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基 -C₁-C₄ 烷基、杂芳基 -C₁-C₄ 烷基和杂环基 -C₁-C₄ 烷基,其中后提到的 6 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的取代基;

[0021] R^e 、 R^f 相互独立地选自氢、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 环烷基甲基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷基羰基、C₁-C₄ 卤代烷基羰基、C₁-C₄ 烷基磺酰基、C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基、苯基、苯基羰基、苯基磺酰基、杂芳基、杂芳基羰基、杂芳基磺酰基、杂环基、杂环基羰基、杂环基磺酰基、苯基 -C₁-C₄ 烷基、杂芳基 -C₁-C₄ 烷基和杂环基 -C₁-C₄ 烷基,其中后提到的 12 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的取代基;或者

[0022] R^e 和 R^f 与它们所键合的氮原子一起形成可以带有选自 O、S 和 N 的另外杂原子作为环成员原子的 5 或 6 员饱和或不饱和杂环,其中该杂环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄

卤代烷氧基的取代基；

[0023] R^g 、 R^h 相互独立地选自氢、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 卤代链烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基- C_1-C_4 烷基、杂芳基- C_1-C_4 烷基和杂环基- C_1-C_4 烷基，其中后提到的 6 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的取代基；

[0024] R^i 选自氢、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 环烷基甲基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 卤代链烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基、苯基和苯基- C_1-C_4 烷基，其中后提到的 2 个基团中的苯基环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的取代基；

[0025] R^x 相互独立地选自氰基、硝基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 卤代烷硫基、 C_1-C_4 烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基、 C_1-C_{10} 烷基羰基、 C_3-C_6 环烷基、5-7 员杂环基、苯基、 C_3-C_6 环烷氧基、3-6 员杂环氧基和苯氧基，其中后提到的 6 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的取代基；

[0026] R^y 选自卤素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 $S(O)_m R^d$ 、 $S(O)_m N R^e R^f$ 、 C_1-C_4 烷基羰基、 C_1-C_4 卤代烷基羰基、 C_1-C_4 烷氧羰基、 C_1-C_4 卤代烷氧羰基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 卤代链烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基、 C_3-C_6 环烷基、5-7 员杂环基、杂芳基、苯基、 C_3-C_6 环烷氧基、3-6 员杂环氧基、杂芳氧基和苯氧基，其中后提到的 8 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的基团。

[0027] 本发明化合物特别可用于防治无脊椎动物害虫，特别是防治节肢动物和线虫，尤其是防治昆虫，特别是防治同翅目 (Homoptera) 昆虫。因此，本发明还涉及式 I 化合物、其互变异构体或 N-氧化物或其盐，尤其是其可农用盐或可兽用盐在防治无脊椎动物害虫中，特别是在防治节肢动物和线虫中，尤其是在防治昆虫中，特别是在防治同翅目昆虫中的用途。

[0028] 本发明的另一方面涉及一种防治无脊椎动物害虫的方法，该方法包括用杀虫有效量的本发明式 I 化合物或其盐或其 N-氧化物或所述 N-氧化物的盐处理害虫、其食物供应源、其栖息地或其繁殖地，或者其中害虫生长或可能生长的栽培植物、植物繁殖材料如种子、土壤、区域、材料或环境，或者要防止害虫侵袭或侵染的材料、植物、种子、土壤、表面或空间。

[0029] 本发明的另一方面涉及一种保护植物繁殖材料，尤其是种子和 / 或由其生长的植物的方法，该方法包括用杀虫有效量的本发明式 I 化合物或其可农用盐、其互变异构体或 N-氧化物或者所述 N-氧化物或所述互变异构体的可农用盐处理植物繁殖材料。

[0030] 本发明的另一方面涉及植物繁殖材料，其包含至少一种本发明式 I 化合物和 / 或其可农用盐或其 N-氧化物或者所述 N-氧化物或所述互变异构体的可农用盐。

[0031] 本发明的另一方面涉及一种农业组合物，其包含至少一种本发明式 I 化合物和 / 或其可农用盐或其 N-氧化物或互变异构体和 / 或所述 N-氧化物或所述互变异构体的可农

用盐和至少一种液体或固体载体。

[0032] 取决于取代方式,式 I 化合物可以具有一个或多个手性中心,此时它们以对映体或非对映体的混合物存在。本发明提供了式 I 的纯对映体或纯非对映体及其混合物二者以及化合物 I 的纯对映体或非对映体或其混合物的本发明用途。合适的式 I 化合物还包括所有可能的几何立体异构体(顺/反异构体)及其混合物。

[0033] 取决于取代方式,式 I 化合物可以以其互变异构体形式存在。因此,本发明还涉及式 I 的互变异构体以及所述互变异构体的盐。

[0034] 式 I 化合物及其 N-氧化物和互变异构体可以是无定形的或者可以以一种或多种不同的晶态存在(多晶形),这些不同的晶态可能具有不同的宏观性能如稳定性或显示不同生物学性能如活性。本发明包括无定形和结晶的式 I 化合物、其互变异构体或 N-氧化物,相应式 I 化合物、其互变异构体或 N-氧化物的不同晶态的混合物及其无定形或结晶盐。

[0035] 式 I 化合物、其互变异构体或 N-氧化物的盐优选为可农用盐和可兽用盐。它们可以常规方法形成,例如若式 I 化合物具有碱性官能团,则通过使该化合物与酸反应或者若式 I 化合物具有酸性官能团,则通过使该化合物与合适的碱反应。

[0036] 合适的可农用盐尤其为其阳离子和阴离子分别对本发明化合物的杀虫作用没有不利影响的那些阳离子的盐或那些酸的酸加成盐。合适的阳离子尤其是碱金属离子,优选锂、钠和钾离子;碱土金属离子,优选钙、镁和钡离子;过渡金属离子,优选锰、铜、锌和铁离子;还有铵(NH_4^+)和其中 1-4 个氢原子被 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 羟基烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、羟基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、苯基或苄基替代的取代铵。取代铵离子的实例包括甲基铵、异丙基铵、二甲基铵、二异丙基铵、三甲基铵、四甲基铵、四乙基铵、四丁基铵、2-羟基乙基铵、2-(2-羟基乙氧基)乙基铵、二(2-羟基乙基)铵、苄基三甲基铵和苄基三乙基铵,此外还有磷离子,铈离子,优选三($\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基)铈,以及氧化铈离子,优选三($\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基)氧化铈。

[0037] 有用酸加成盐的阴离子主要是氯离子、溴离子、氟离子、硫酸氢根、硫酸根、磷酸二氢根、磷酸氢根、磷酸根、硝酸根、碳酸氢根、碳酸根、六氟硅酸根、六氟磷酸根、苯甲酸根和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 链烷酸的阴离子,优选甲酸根、乙酸根、丙酸根和丁酸根。它们可以通过使式 I 化合物与对应阴离子的酸,优选盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸或硝酸反应而形成。

[0038] 术语“N-氧化物”包括具有至少一个被氧化成 N-氧化物结构部分的叔氮原子的任何式 I 化合物。

[0039] 本文所用术语“无脊椎动物害虫”包括动物种群,如节肢动物害虫,包括昆虫和蜘蛛以及线虫,这些害虫可能侵袭植物,从而对受侵袭的植物产生显著损害,以及可能侵染动物,尤其是温血动物,如哺乳动物或鸟类或其他高等动物如爬行动物、两栖动物或鱼类,从而对受侵染的动物产生显著损害的体外寄生虫。

[0040] 本文所用术语“植物繁殖材料”包括植物的所有繁殖部分如种子,以及可以用于繁殖植物的无性植物材料如插条和块茎(例如土豆)。这包括种子、根、果实、块茎、球茎、地下茎、嫩枝、芽和其他植物部分。还可包括在萌发后或出苗后由土壤移植的秧苗和幼苗。这些植物繁殖材料可以在种植或移栽之时或之前用植物保护化合物预防性处理。

[0041] 术语“植物”包括任何类型的植物,这包括“非栽培植物”和尤其是“栽培植物”。

[0042] 术语“非栽培植物”是指任何野生类型的品种或相关品种或者栽培植物的相关属。

[0043] 本文所用术语“栽培植物”包括已经通过育种、诱变或基因工程修饰的植物。基因修饰植物是其基因材料通过使用在自然条件下不易通过杂交、突变或自然重组得到的重组 DNA 技术修饰的植物。通常将一个或多个基因整合到基因修饰植物的基因材料中以改善植物的某些性能。

[0044] 在各变量的上述定义中提到的有机结构部分象术语卤素一样为各基团成员的各次列举的集合性术语。前缀 C_n-C_m 在每种情况下表示该基团中可能的碳原子数。

[0045] 术语卤素在每种情况下表示氟、溴、氯或碘,尤其是氟、氯或溴。

[0046] 本文所用以及在烷氧基、烷基羰基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基和烷氧基烷基的烷基结构部分中的术语“烷基”在每种情况下表示通常具有 1-10 个碳原子,常常为 1-6 个碳原子,优选 1-4 个碳原子,尤其是 1-3 个碳原子的直链或支化烷基。烷基的实例是甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、2-丁基、异丁基、叔丁基、正戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、正己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基、1-乙基-2-甲基丙基、正庚基、1-甲基己基、2-甲基己基、3-甲基己基、4-甲基己基、5-甲基己基、1-乙基戊基、2-乙基戊基、3-乙基戊基、1-丙基戊基、正辛基、1-甲基辛基、2-甲基庚基、1-乙基己基、2-乙基己基、1,2-二甲基己基、1-丙基戊基和 2-丙基戊基。

[0047] 本文所用术语“亚烷基”(或链烷二基)在每种情况下表示如上所定义的烷基,其中在碳骨架的任意位置的一个氢原子被一个另外的键合位置替代,由此形成二价结构部分。

[0048] 本文所用以及在卤代烷氧基、卤代烷硫基、卤代烷基羰基、卤代烷基磺酰基和卤代烷基亚磺酰基的卤代烷基结构部分中的术语“卤代烷基”在每种情况下表示通常具有 1-10 个碳原子,常常为 1-6 个碳原子的直链或支化烷基,其中该基团的氢原子部分或完全被卤原子替代。优选的卤代烷基结构部分选自 C_1-C_4 卤代烷基,更优选 C_1-C_2 卤代烷基,尤其是 C_1-C_2 氟代烷基,如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、五氟乙基等。

[0049] 本文所用术语“烷氧基”在每种情况下表示经由氧原子键合且通常具有 1-10 个碳原子,常常为 1-6 个碳原子,优选 1-4 个碳原子的直链或支化烷基。烷氧基的实例是甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、2-丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等。

[0050] 本文所用术语“卤代烷氧基”在每种情况下表示具有 1-10 个碳原子,常常为 1-4 个碳原子,优选 1-3 个碳原子的直链或支化烷氧基,其中该基团的氢原子部分或完全被卤原子,尤其是氟原子替代。优选的卤代烷氧基结构部分包括 C_1-C_4 卤代烷氧基,尤其是 C_1-C_2 氟代烷氧基,如氟代甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、1-氟乙氧基、2-氟乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、五氟乙氧基等。

[0051] 本文所用以及在环烷氧基和环烷基甲基的环烷基结构部分中的术语“环烷基”在每种情况下表示通常具有 3-10 个碳原子或 3-6 个碳原子的单环或双环脂环族基团,如环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、双环 [2.1.1] 己基、双环 [3.1.1] 庚基、双环

[2.2.1] 庚基和双环 [2.2.2] 辛基。

[0052] 本文所用术语“ C_n-C_m 环烷基- C_o-C_p 烷基”等是指如上所定义的具有 $n-m$ 个碳原子的环烷基,其经由如上所定义的具有 $o-p$ 个碳原子的烷基键合于该分子的剩余部分。实例是环丙基甲基、环丙基乙基、环丙基丙基、环丁基甲基、环丁基乙基、环丁基丙基、环戊基甲基、环戊基乙基、环戊基丙基、环己基甲基、环己基乙基、环己基丙基等。

[0053] 本文所用以及在卤代环烷基甲基的卤代环烷基结构部分中的术语“卤代环烷基”在每种情况下表示通常具有 3-10 个碳原子或 3-6 个碳原子的单环或双环脂环族基团,其中氢原子中的至少一个,例如 1、2、3、4 或 5 个被卤素,尤其是氟或氯替代。实例是 1- 和 2- 氟环丙基,1,2-、2,2- 和 2,3- 二氟环丙基,1,2,2- 三氟环丙基,2,2,3,3- 四氟环丙基,1- 和 2- 氯环丙基,1,2-、2,2- 和 2,3- 二氯环丙基,1,2,2- 三氯环丙基,2,2,3,3- 四氯环丙基,1-、2- 和 3- 氟环戊基,1,2-、2,2-、2,3-、3,3-、3,4-、2,5- 二氟环戊基,1-、2- 和 3- 氯环戊基,1,2-、2,2-、2,3-、3,3-、3,4-、2,5- 二氯环戊基等。

[0054] 本文所用术语“链烯基”在每种情况下表示通常具有 2-10 个,优选 2-4 个碳原子的单不饱和烃基,例如乙烯基、烯丙基(2- 丙烯-1- 基)、1- 丙烯-1- 基、2- 丙烯-2- 基、甲代烯丙基(2- 甲基丙-2- 烯-1- 基)、2- 丁烯-1- 基、3- 丁烯-1- 基、2- 戊烯-1- 基、3- 戊烯-1- 基、4- 戊烯-1- 基、1- 甲基丁-2- 烯-1- 基、2- 乙基丙-2- 烯-1- 基等。

[0055] 本文所用术语“炔基”在每种情况下表示通常具有 2-10 个,优选 2-4 个碳原子的单不饱和烃基,例如乙炔基、炔丙基(2- 丙炔-1- 基)、1- 丙炔-1- 基、1- 甲基丙-2- 炔-1- 基、2- 丁炔-1- 基、3- 丁炔-1- 基、1- 戊炔-1- 基、3- 戊炔-1- 基、4- 戊炔-1- 基、1- 甲基丁-2- 炔-1- 基、1- 乙基丙-2- 炔-1- 基等。

[0056] 本文所用术语“烷氧基烷基”是指通常包含 1-4 个碳原子的烷基,其中 1 个碳原子带有通常包含 1-10 个,尤其是 1-4 个碳原子的如上所定义的烷氧基。实例是 CH_3OCH_3 、 $CH_3OCH_2CH_3$ 、正丙氧基甲基、 $CH_3OCH(CH_3)_2$ 、正丁氧基甲基、(1- 甲基丙氧基) 甲基、(2- 甲基丙氧基) 甲基、 $CH_3OCH(CH_3)_3$ 、2- 甲氧基乙基、2- 乙氧基乙基、2- 正丙氧基乙基、2-(1- 甲基乙氧基) 乙基、2- 正丁氧基乙基、2-(1- 甲基丙氧基) 乙基、2-(2- 甲基丙氧基) 乙基、2-(1,1- 二甲基乙氧基) 乙基、2- 甲氧基丙基、2- 乙氧基丙基、2- 正丙氧基丙基、2-(1- 甲基乙氧基) 丙基、2- 正丁氧基丙基、2-(1- 甲基丙氧基) 丙基、2-(2- 甲基丙氧基) 丙基、2-(1,1- 二甲基乙氧基) 丙基、3- 甲氧基丙基、3- 乙氧基丙基、3- 正丙氧基丙基、3-(1- 甲基乙氧基) 丙基、3- 正丁氧基丙基、3-(1- 甲基丙氧基) 丙基、3-(2- 甲基丙氧基) 丙基、3-(1,1- 二甲基乙氧基) 丙基、2- 甲氧基丁基、2- 乙氧基丁基、2- 正丙氧基丁基、2-(1- 甲基乙氧基) 丁基、2- 正丁氧基丁基、2-(1- 甲基丙氧基) 丁基、2-(2- 甲基丙氧基) 丁基、2-(1,1- 二甲基乙氧基) 丁基、3- 甲氧基丁基、3- 乙氧基丁基、3- 正丙氧基丁基、3-(1- 甲基乙氧基) 丁基、3- 正丁氧基丁基、3-(1- 甲基丙氧基) 丁基、3-(2- 甲基丙氧基) 丁基、3-(1,1- 二甲基乙氧基) 丁基、4- 甲氧基丁基、4- 乙氧基丁基、4- 正丙氧基丁基、4-(1- 甲基乙氧基) 丁基、4- 正丁氧基丁基、4-(1- 甲基丙氧基) 丁基、4-(2- 甲基丙氧基) 丁基、4-(1,1- 二甲基乙氧基) 丁基等。

[0057] 本文所用术语“烷基羰基”(烷基- $C(=O)-$)是指通过羰基的碳原子在烷基的任意位置连接的包含 1-10 个碳原子($=C_1-C_{10}$ 烷基羰基),优选 1-4 个碳原子($=C_1-C_4$ 烷基羰基)的如上所定义直链或支化饱和烷基。

[0058] 本文所用术语“卤代烷基羰基”是指如上所定义的烷基羰基,其中氢原子部分或完全被氟、氯、溴和 / 或碘替代。

[0059] 本文所用术语“烷硫基(也为烷基硫基或烷基-S-)”是指包含 1-10 个碳原子(=C₁-C₁₀ 烷硫基),优选 1-4 个碳原子(=C₁-C₄ 烷硫基)的如上所定义的直链或支化饱和烷基,其经由硫原子在烷基中的任意位置连接。

[0060] 本文所用术语“卤代烷硫基”是指如上所定义的烷硫基,其中氢原子部分或完全被氟、氯、溴和 / 或碘替代。

[0061] 本文所用术语“烷基亚磺酰基”(也为烷基次磺酰基(alkylsulfoxyl)或烷基-S(=O)-)是指通过亚磺酰基的硫原子在烷基的任意位置连接的包含 1-10 个碳原子(=C₁-C₁₀ 烷基亚磺酰基),优选 1-4 个碳原子(=C₁-C₄ 烷基亚磺酰基)的如上所定义的直链或支化饱和烷基。

[0062] 本文所用术语“卤代烷基亚磺酰基”是指其中氢原子部分或完全被氟、氯、溴和 / 或碘替代的如上所定义的烷基亚磺酰基。

[0063] 本文所用术语“烷基磺酰基”(也为烷基-S(=O)₂-)是指通过磺酰基的硫原子在烷基的任意位置连接的包含 1-10 个碳原子(=C₁-C₁₀ 烷基磺酰基),优选 1-4 个碳原子(=C₁-C₄ 烷基磺酰基)的如上所定义的直链或支化饱和烷基。

[0064] 本文所用术语“卤代烷基磺酰基”是指其中氢原子部分或完全被氟、氯、溴和 / 或碘替代的如上所定义的烷基磺酰基。

[0065] 术语“杂环基”通常包括 3、4、5、6、7 或 8 员,尤其是 5、6、7 或 8 员单环杂环非芳族基团和 8-10 员双环杂环非芳族基团,该单环和双环非芳族基团可以是饱和或不饱和的。该单环和双环杂环非芳族基团通常包含 1、2、3 或 4 个杂原子,尤其是 1 或 2 个选自 N、O 和 S 的杂原子作为环成员,其中作为环成员的 S 原子可以作为 S、SO 或 SO₂ 存在。饱和或不饱和 3、4、5、6、7 或 8 员杂环基团的实例包括饱和或不饱和非芳族杂环,如环氧乙烷基、氧杂环丁烷基、硫杂环丁烷基、硫杂环丁烷基-S-氧化物(S-氧代硫杂环丁烷基)、硫杂环丁烷基-S-二氧化物(S-二氧化硫杂环丁烷基)、吡咯烷基、吡唑啉基、咪唑啉基、吡咯啉基、吡唑啉基、咪唑啉基、四氢呋喃基、二氢呋喃基、1,3-二氧戊环基、二氧杂环戊烯基(dioxolenyl)、硫杂戊环基(thiolanyl)、S-氧代硫杂戊环基、S-二氧化硫杂戊环基、二氢噻吩基、S-氧代二氢噻吩基、S-二氧化二氢噻吩基、噁唑烷基、异噁唑烷基、噁唑啉基、异噁唑啉基、噻唑啉基、异噻唑啉基、噻唑烷基、异噻唑烷基、氧硫杂戊环基(oxathiolanyl)、哌啶基、哌嗪基、吡喃基、二氢吡喃基、四氢吡喃基、1,3-和 1,4-二噁烷基、噻喃基、S-氧代噻喃基、S-二氧化噻喃基、二氢噻喃基、S-氧代二氢噻喃基、S-二氧化二氢噻喃基、四氢噻喃基、S-氧代四氢噻喃基、S-二氧化四氢噻喃基、吗啉基、硫吗啉基、2-氧代硫吗啉基、2-二氧化硫吗啉基、噻嗪基等。也包含 1 或 2 个羰基作为环成员的杂环实例包括吡咯烷-2-酮基、吡咯烷-2,5-二酮基、咪唑烷-2-酮基、噁唑烷-2-酮基、噻唑烷-2-酮基等。

[0066] 术语“杂芳基”通常包括 5 或 6 员不饱和单环杂环基团和 8-10 员不饱和双环杂环基团,该单环或双环基团为芳族的,即它们符合 Hückel 规则(4n+2 规则)。杂芳基通常包含 1、2、3 或 4 个选自 N、O 和 S 的杂原子作为环成员。

[0067] 术语“杂芳基”包括包含 1、2、3 或 4 个选自 N、O 和 S 的杂原子作为环成员的单环

5 或 6 员杂芳族基团。5 或 6 员杂芳族基团的实例包括吡啶基, 即 2-、3- 或 4- 吡啶基, 嘧啶基, 即 2-、4- 或 5- 嘧啶基, 吡嗪基, 哒嗪基, 即 3- 或 4- 哒嗪基, 噻吩基, 即 2- 或 3- 噻吩基, 呋喃基, 即 2- 或 3- 呋喃基, 吡咯基, 即 2- 或 3- 吡咯基, 噁唑基, 即 2-、3- 或 5- 噁唑基, 异噁唑基, 即 3-、4- 或 5- 异噁唑基, 噻唑基, 即 2-、3- 或 5- 噻唑基, 异噻唑基, 即 3-、4- 或 5- 异噻唑基, 吡唑基, 即 1-、3-、4- 或 5- 吡唑基, 即 1-、2-、4- 或 5- 咪唑基, 噁二唑基, 例如 2- 或 5-[1, 3, 4] 噁二唑基, 4- 或 5-(1, 2, 3- 噁二唑) 基, 3- 或 5-(1, 2, 4- 噁二唑) 基, 2- 或 5-(1, 3, 4- 噻二唑) 基, 噻二唑基, 例如 2- 或 5-(1, 3, 4- 噻二唑) 基, 4- 或 5-(1, 2, 3- 噻二唑) 基, 3- 或 5-(1, 2, 4- 噻二唑) 基, 三唑基, 例如 1H-、2H- 或 3H-1, 2, 3- 三唑-4- 基, 2H- 三唑-3- 基, 1H-、2H- 或 4H-1, 2, 4- 三唑基和四唑基, 即 1H- 或 2H- 四唑基。

[0068] 术语“杂芳基”还包括包含 1、2 或 3 个选自 N、O 和 S 的杂原子作为环成员的双环 8-10 员杂芳族基团, 其中 5 或 6 员杂芳族环与苯基环或与 5 或 6 员杂芳族基团稠合。与苯基环或与 5 或 6 员杂芳族基团稠合的 5 或 6 员杂芳族环实例包括苯并呋喃基、苯并噻吩基、吲哚基、吲唑基、苯并咪唑基、苯并噁噻唑基 (benzoxathiazolyl)、苯并噁二唑基、苯并噻二唑基、苯并噁嗪基、喹啉基、异喹啉基、嘌呤基、1, 8- 二氮杂萘基、蝶啶基、吡啶并 [3, 2-d] 嘧啶基或吡啶并咪唑基等。这些稠合杂芳基可以经由 5 或 6 员杂芳族环的任何环原子或经由稠合苯基结构部分的碳原子与该分子的剩余部分键合。

[0069] 术语“苯基烷基”和“苯氧基烷基”分别是指经由烷基, 尤其是甲基 (= 杂芳基甲基) 与该分子的剩余部分键合的苯基或苯氧基, 实例包括苄基、1- 苯基乙基、2- 苯基乙基、2- 苯氧基乙基等。

[0070] 术语“杂环基烷基”和“杂芳基烷基”分别是指经由亚烷基, 尤其是亚甲基 (分别为杂环基甲基或杂芳基甲基) 或 1, 1- 亚乙基或 1, 2- 亚乙基 (分别为 1- 杂环基乙基、2- 杂环基乙基、1- 杂芳基乙基或 2- 杂芳基乙基) 与该分子的剩余部分键合的如上所定义的杂环基或杂芳基。

[0071] 下面就式 I 化合物的各变量 (取代基) 的优选实施方案所作描述单独有效, 并且优选相互组合有效。

[0072] 下面就各变量的优选实施方案所作描述进一步对式 I 化合物、本发明的用途和方法及本发明组合物有效。

[0073] 本发明的第一优选实施方案涉及其中 X 为 O 的式 I 的杂芳基 (硫代) 羧酰胺化合物、其 N- 氧化物、互变异构体及其盐以及该类化合物的方法和用途。这些化合物在下文也称为式 I1 化合物。

[0074] 本发明的另一实施方案涉及其中 X 为 S 的式 I 的杂芳基 (硫代) 羧酰胺化合物、其 N- 氧化物、互变异构体及其盐以及该类化合物的方法和用途。

[0075] 本发明的特殊实施方案涉及式 I 的吡唑化合物、其 N- 氧化物、互变异构体及其盐, 其中 R¹ 具有下列含义:

[0076] R¹ 为 CN、C₁-C₁₀ 烷基、C₁-C₁₀ 卤代烷基、C₃-C₁₀ 环烷基、C₃-C₁₀ 卤代环烷基、C₃-C₁₀ 环烷基甲基、C₃-C₁₀ 卤代环烷基甲基、C₂-C₁₀ 链烯基、C₂-C₁₀ 卤代链烯基、C₂-C₁₀ 炔基、C₃-C₁₀ 卤代炔基、C₁-C₄ 亚烷基 -CN、C₁-C₄ 亚烷基 -OR^a、C(Y)R^b、C₁-C₄ 亚烷基 -C(Y)R^b、C(Y)OR^c、C₁-C₄ 亚烷

基 $-C(Y)OR^c$ 、 $S(O)_2R^d$ 、 C_1-C_4 亚烷基 $-NR^eR^f$ 、 $C(Y)NR^gR^h$ 、 C_1-C_4 亚烷基 $-C(Y)NR^gR^h$ 、 $S(O)_mNR^eR^f$ 、 $C(Y)NR^iNR^eR^f$ 、苯基、杂芳基、5 或 6 员杂环基、苯基 $-C_1-C_4$ 烷基和 5 或 6 员杂环基 $-C_1-C_4$ 烷基或 5 或 6 员杂芳基 $-C_1-C_4$ 烷基，其中后提到的 6 个基团的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个，尤其是 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^y 并且其中 m 为 0、1 或 2；

[0077] 其中基团 R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e 、 R^f 、 R^g 、 R^h 、 R^i 和 R^y 如上所定义且其中 R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e 、 R^f 、 R^g 、 R^h 、 R^i 和 R^y 在存在时优选具有作为优选含义给出的含义之一。

[0078] 在式 I 化合物中，进一步优选与 R^1 本身有关或者与 A 和 / 或 X 组合考虑的本发明各实施方案。

[0079] 优选基团 R^1 的实例包括：

[0080] $-C_1-C_{10}$ 烷基，尤其是 C_1-C_4 烷基，如甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、叔丁基或 2- 甲基丙基；

[0081] $-C_1-C_{10}$ 卤代烷基，尤其是 C_1-C_4 卤代烷基，如 2- 氟乙基、2- 氯乙基、2- 溴乙基、2, 2- 二氟乙基、2, 2- 二氯乙基、2, 2- 二溴乙基或 2, 2, 2- 三氟乙基； $-C_3-C_{10}$ 链烯基，尤其是 C_3-C_4 链烯基，如 2- 丙烯基、顺式或反式 -2- 丁烯 -1- 基；

[0082] $-C_3-C_4$ 卤代链烯基，如 3, 3- 二氯 -2- 丙烯基或 3, 3- 二溴 -2- 丙烯基；

[0083] $-C_3-C_{10}$ 炔基，尤其是 C_3-C_4 炔基，如炔丙基、1- 甲基炔丙基或 2- 丁炔 -1- 基；

[0084] $-C_1-C_4$ 亚烷基 $-CN$ ，如氰基甲基或氰基乙基；

[0085] $-C_1-C_4$ 亚烷基 $-OR^a$ ，如甲氧基甲基、乙氧基甲基、2- 甲氧基乙基或 2- 乙氧基乙基；

[0086] $-C_1-C_4$ 亚烷基 $-NR^eR^f$ ，如 2- (二甲氨基) 乙基；

[0087] $-C_1-C_4$ 亚烷基 $-C(Y)NR^gR^h$ ，如 N, N- 二甲基氨基甲酰基甲基或 N, N- 二甲基硫代氨基甲酰基甲基；

[0088] $-C_3-C_6$ 环烷基，如环丙基、环丁基或环戊基；

[0089] $-C_3-C_6$ 环烷基 $-C_1-C_4$ 烷基，尤其是 C_3-C_6 环烷基甲基、1- C_3-C_6 环烷基乙基或 2- C_3-C_6 环烷基乙基，如环丙基甲基、环丁基甲基或环戊基甲基；

[0090] - 可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个，尤其是 1、2 或 3 个如本文所定义的基团 R^y 的苯基；

[0091] - 苯基 $-C_1-C_4$ 烷基，尤其是苄基、1- 苄基乙基或 2- 苄基乙基，其中苯基可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个，尤其是 1、2 或 3 个如本文所定义的基团 R^y ，例如苄基；

[0092] - 杂环基 $-C_1-C_4$ 烷基，尤其是杂环基甲基、1- 杂环基乙基或 2- 杂环基乙基，其中杂环基可以未被取代或者可以带有 1、2 或 3 个如上所定义的基团 R^y ，例如氧杂环丁烷 -2- 基甲基、氧杂环丁烷 -3- 基甲基、硫杂环丁烷 -3- 基甲基、3, 3- 二氧杂硫杂环丁烷 -3- 基甲基、氧杂环戊烷 (oxolan) -2- 基甲基、氧杂环戊烷 -3- 基甲基、噁唑啉 -2- 基甲基、噁唑啉 -2- 基甲基、1H- 咪唑啉 -2- 基甲基、1- 甲基 -1H- 咪唑啉 -2- 基甲基或 5, 5- 二甲基四氢呋喃 -2- 基甲基；和

[0093] - 可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个，尤其是 1、2 或 3 个如本文所定义的基团 R^y 的杂芳基，例如 2- 呋喃基、3- 呋喃基、5- 甲基呋喃 -2- 基、2- 噻吩基、3- 噻吩基、异噻唑 -3- 基、异噻唑 -4- 基、异噻唑 -5- 基、异噁唑 -3- 基、异噁唑 -4- 基、异噁唑 -5- 基、噁唑 -2- 基、噁唑 -4- 基、噁唑 -5- 基、噻唑 -2- 基、噻唑 -4- 基、噻唑 -5- 基、1H- 吡

唑-3-基、1H-吡唑-4-基、2H-吡唑-3-基、1-甲基-1H-吡唑-3-基、1-甲基-1H-吡唑-4-基、1-苯基-1H-吡唑-4-基、2-甲基-2H-吡唑-3-基、1H-咪唑-2-基、1H-咪唑-4-基、1H-咪唑-5-基、1-甲基-1H-咪唑-2-基、1-甲基-1H-咪唑-4-基、1-甲基-1H-咪唑-5-基、2-吡啶基或3-吡啶基；

[0094] -杂芳基-C₁-C₄烷基，尤其是杂芳基甲基、1-杂芳基乙基或2-杂芳基乙基，其中杂芳基可以未被取代或者可以带有1、2或3个如上所定义的基团R^y，例如2-呋喃基甲基、3-呋喃基甲基、5-甲基呋喃-2-基甲基、2-噻吩基甲基、3-噻吩基甲基、异噻唑-3-基甲基、异噻唑-4-基甲基、异噻唑-5-基甲基、异噁唑-3-基甲基、异噁唑-4-基甲基、异噁唑-5-基甲基、噁唑-2-基甲基、噁唑-4-基甲基、噁唑-5-基甲基、噁唑-2-基甲基、噁唑-4-基甲基、噁唑-5-基甲基、1H-吡唑-3-基甲基、1H-吡唑-4-基甲基、2H-吡唑-3-基甲基、1-甲基-1H-吡唑-3-基甲基、1-甲基-1H-吡唑-4-基甲基、1-苯基-1H-吡唑-4-基甲基、2-甲基-2H-吡唑-3-基甲基、1H-咪唑-2-基甲基、1H-咪唑-4-基甲基、1H-咪唑-5-基甲基、1-甲基-1H-咪唑-2-基甲基、1-甲基-1H-咪唑-4-基甲基、1-甲基-1H-咪唑-5-基甲基、2-吡啶基甲基或3-吡啶基甲基。

[0095] 本发明的特殊实施方案涉及如下式I化合物，其中R¹选自C₁-C₁₀烷基，C₁-C₁₀卤代烷基，C₃-C₁₀链烯基，C₃-C₁₀炔基，C₁-C₄亚烷基-CN，C₁-C₄亚烷基-OR^a，苯基-C₁-C₄烷基，尤其是苄基，C₃-C₁₀环烷基-C₁-C₄烷基，尤其是环烷基甲基，5或6员饱和杂环基-C₁-C₄烷基，尤其是杂环基甲基，以及5或6员杂芳基-C₁-C₄烷基，尤其是杂芳基甲基，其中C₃-C₁₀环烷基-C₁-C₄烷基和杂环基-C₁-C₄烷基中的环烷基环和杂环基环分别未被取代或者带有1、2、3、4或5个，尤其是1、2或3个相同或不同的取代基R^y，其中苯基-C₁-C₄烷基和杂芳基-C₁-C₄烷基中的苯基环和杂芳基环分别未被取代或者带有1、2、3、4或5个，尤其是1、2或3个相同或不同的取代基R^y，其中R^a和R^y如本文所定义且其中R^a和R^y在存在时优选具有作为优选含义给出的含义之一以及其中R^a尤其选自氢、C₁-C₄烷基和C₁-C₄卤代烷基且其中R^y尤其选自卤素、NO₂、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄卤代烷氧基、C₁-C₄烷基磺酰基和C₁-C₄卤代烷基磺酰基。

[0096] 在该实施方案以及下述实施方案中，基团R¹的实例为下列基团，它们本身涉及式I化合物的特殊实施方案：甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、丁基、仲丁基、异丁基、1-甲氧基乙基、2-甲氧基乙基、1-乙氧基乙基、2-乙氧基乙基、环丙基甲基、氰基甲基、1-氰基乙基、2-氰基乙基、环丙基、2,2,2-三氟乙基、吡啶-2-基甲基、吡啶-3-基甲基、吡啶-4-基甲基、呋喃-2-基甲基、呋喃-3-基甲基、噻吩-2-基甲基、噻吩-3-基甲基、四氢呋喃-2-基甲基、四氢呋喃-3-基甲基、吡咯-2-基甲基、吡咯-3-基甲基、1-甲基吡咯-2-基甲基、1-甲基吡咯-3-基甲基、苄基、烯丙基、顺式-或反式-2-丁烯-1-基、炔丙基和丁-2-炔基。

[0097] 本发明的实施方案涉及式I化合物、其N-氧化物及其盐，其中取代基R¹的上述实例与其他R¹组合。

[0098] 本发明的另一实施方案涉及式I化合物、其N-氧化物及其盐，其中取代基R¹的上述实例不与其他R¹组合。

[0099] 本发明的另一实施方案涉及式I化合物、其N-氧化物及其盐，其中R¹选自CN、C₁-C₁₀烷基、C₁-C₁₀卤代烷基、C₃-C₁₀链烯基、C₃-C₁₀卤代链烯基、C₃-C₁₀炔基、C₁-C₄亚烷基-CN和C₁-C₄亚烷基-OR^a，尤其选自CN、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₃-C₄链烯基、C₃-C₄卤代链烯

基、 C_3-C_4 炔基、 C_1-C_4 亚烷基 $-CN$ 和 C_1-C_4 亚烷基 $-OR^a$, 其中 R^a 如本文所定义且其中 R^a 在存在时优选具有作为优选含义给出的含义之一以及其中 R^a 尤其选自氢、 C_1-C_4 烷基和 C_1-C_4 卤代烷基。

[0100] 本发明的另一实施方案涉及式 I 化合物、其 N-氧化物及其盐, 其中 R^1 选自 C_1-C_4 亚烷基 $-CN$, C_1-C_4 亚烷基 $-OR^a$, C_1-C_4 亚烷基 $-C(Y)R^b$, C_1-C_4 亚烷基 $-NR^eR^f$, C_1-C_4 亚烷基 $-C(Y)NR^gR^h$, 苯基 $-C_1-C_4$ 烷基, 尤其是苄基, 杂环基 $-C_1-C_4$ 烷基, 尤其是杂环基甲基, 以及杂芳基 $-C_1-C_4$ 烷基, 尤其是杂芳基甲基, 其中后提到的 6 个基团中的苯基、杂环基或杂芳基环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个如本文所定义且优选分别选自 NO_2 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷基磺酰基和 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基或选自卤素、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基的基团 R^y 。

[0101] 本发明的另一具体实施方案涉及式 I 化合物、其 N-氧化物及其盐, 其中 R^1 选自苯基和杂芳基, 尤其是苯基, 其中苯基和杂芳基未被取代或者带有 1、2、3、4 或 5 个如本文所定义且优选分别选自 NO_2 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷基磺酰基和 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基或选自卤素、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基的基团 R^y 。

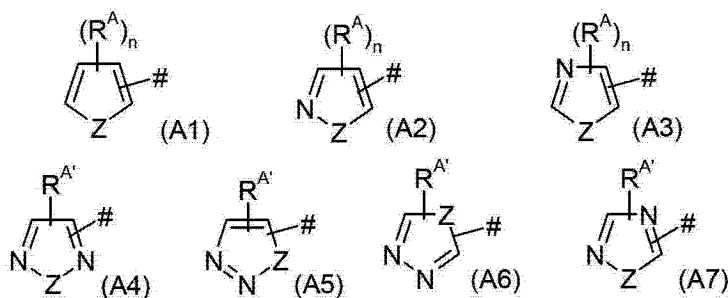
[0102] 本发明的特别优选实施方案涉及式 I 化合物、其 N-氧化物及其盐, 其中 R^1 选自 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基和 C_1-C_4 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷基。在该实施方案中, 特别优选其中 R^1 为 C_1-C_3 烷基的化合物。此外, 在该实施方案中, 同样优选其中 R^1 为 C_1-C_3 卤代烷基或 C_1-C_2 烷氧基 $-C_1-C_2$ 烷基的化合物。

[0103] 在另一特殊实施方案中, 本发明涉及式 I 化合物、其 N-氧化物及其盐, 其中 R^1 选自 C_1-C_4 亚烷基 $-NR^eR^f$, 苯基 $-C_1-C_4$ 烷基, 尤其是苄基、1- 苄基乙基或 2- 苄基乙基, 杂环基 $-C_1-C_4$ 烷基, 尤其是杂环基甲基、1- 杂环基乙基或 2- 杂环基乙基, 以及杂芳基 $-C_1-C_4$ 烷基, 尤其是杂芳基甲基、1- 杂芳基乙基或 2- 杂芳基乙基, 其中后提到的 12 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2 或 3 个如上所定义且优选选自卤素、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷基磺酰基和 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基的基团 R^y 。

[0104] 基团 R^a 若存在的话则选自卤素、 CN 、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基和 C_2-C_{10} 链烯基, 其中后提到的 2 个基团可以未被取代、可以部分或完全被卤代或者可以带有 1、2 或 3 个选自如下的相同或不同取代基: C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_3-C_6 环烷基、杂芳基、苯基和苯氧基, 其中后提到的 3 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷基磺酰基和 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基的基团, 或者其中 R^a 进一步选自 C_3-C_6 环烷基、 C_5-C_6 杂芳基和苯基, 其中后提到的 3 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷基磺酰基和 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基的相同或不同取代基。具体而言, 基团 R^a 若存在的话则选自卤素、 CN 、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 卤代环烷基和苯基, 其中苯基可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的基团。更优选基团 R^a 若存在的话则选自卤素、 CN 、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基和 C_3-C_6 卤代环烷基。甚至更优选 R^a 若存在的话则选自卤素、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基和 C_3-C_6 卤代环烷基。更具体而言, R^a 若存在的话则为卤素、 C_1-C_2 烷基或 C_1-C_2 卤代烷基。

[0105] 本发明的特别优选实施方案涉及式 I 化合物、其 N-氧化物及其盐,其中 A 为具有式 A1、A2、A3、A4、A5、A6 或 A7 之一的 5 员杂芳基:

[0106]



[0107] 其中 # 表示与式 I 的剩余部分的连接点,

[0108] Z 为 O、S 或 N-R^N,其中 R^N 如本文所定义,

[0109] n 为 0、1、2 或 3,

[0110] R^A 如本文所定义,以及

[0111] R^{A'} 为氢或具有对 R^A 所给含义之一。

[0112] 在式 A1、A2 和 A3 中,变量 n 优选为 0 或 1,尤其是 1。

[0113] 在其中变量 n 为 2 或 3 的式 A1、A2 和 A3 中, R^A 可以相同或不同。

[0114] 在式 A1、A2 和 A3 中,基团 R^A 若存在的话则选自卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基和 C₂-C₁₀ 链烯基,其中后提到的 2 个基团可以未被取代、可以部分或完全被卤代或者可以带有 1、2 或 3 个选自如下的相同或不同取代基: C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₃-C₆ 环烷基、杂芳基、苯基和苯氧基,其中后提到的 3 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基磺酰基和 C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基,或者其中 R^A 进一步选自 C₃-C₆ 环烷基、C₅-C₆ 杂芳基和苯基,其中后提到的 3 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基磺酰基和 C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基的相同或不同取代基。具体而言,基团 R^A 若存在的话则选自卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 卤代环烷基和苯基,其中苯基可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的基团。更优选基团 R^A 若存在的话则选自卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基和 C₃-C₆ 卤代环烷基。甚至更优选 R^A 若存在的话则选自卤素、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基和 C₃-C₆ 卤代环烷基。更具体而言, R^A 若存在的话则为 C₁-C₂ 烷基或 C₁-C₂ 卤代烷基。

[0115] 在式 A4、A5、A6 和 A7 中,基团 R^{A'} 可以为氢。在式 A4、A5、A6 和 A7 中,基团 R^{A'} 若不为氢的话则优选选自卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基和 C₂-C₁₀ 链烯基,其中后提到的 2 个基团可以未被取代、可以部分或完全被卤代或者可以带有 1、2 或 3 个选自如下的相同或不同取代基: C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₃-C₆ 环烷基、杂芳基、苯基和苯氧基,其中后提到的 3 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基磺酰基和 C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基的基团,或者其中 R^{A'} 进一步选自 C₃-C₆ 环烷基、C₅-C₆ 杂芳基和苯基,其中后提到的 3 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基磺酰基和 C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基的相同或不同取代基。具体而言,基团

$R^{A'}$ 若不为氢的话则选自卤素、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 卤代环烷基和苯基,其中苯基可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的基团。更优选基团 $R^{A'}$ 若不为氢的话则选自卤素、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基和 C_3-C_6 卤代环烷基。甚至更优选 $R^{A'}$ 若不为氢的话则选自卤素、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基和 C_3-C_6 卤代环烷基。更具体而言, $R^{A'}$ 若不为氢的话则为 C_1-C_2 烷基或 C_1-C_2 卤代烷基。

[0116] 基团 A 的特殊实施方案为式 A1、A2、A3、A4、A5、A6 和 A7 的基团,其中 Z 为 $N-R^N$,其中 $N-R^N$ 如上所定义且其中 R^N 优选选自 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 链烯基和 C_2-C_{10} 炔基,其中后提到的 3 个基团可以未被取代、可以被部分或完全卤代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^x ,或者其中 R^N 进一步选自 OR^a 、 $C(Y)R^b$ 、 $C(Y)OR^c$ 、 $S(O)_mR^d$ 、 NR^eR^f 、 $C(Y)NR^gR^h$ 、 $S(O)_mNR^eR^f$ 、 $C(Y)NR^iNR^eR^f$ 、 C_1-C_5 亚烷基 $-OR^a$ 、 C_1-C_5 亚烷基 $-CN$ 、 C_1-C_5 亚烷基 $-C(Y)R^b$ 、 C_1-C_5 亚烷基 $-C(Y)OR^c$ 、 C_1-C_5 亚烷基 $-NR^eR^f$ 、 C_1-C_5 亚烷基 $-C(Y)NR^gR^h$ 、 C_1-C_5 亚烷基 $-S(O)_mR^d$ 、 C_1-C_5 亚烷基 $-S(O)_mNR^eR^f$ 、 C_1-C_5 亚烷基 $-NR^iNR^eR^f$ 、杂环基、杂芳基、 C_3-C_{10} 环烷基、 C_5-C_{10} 环烯基、杂环基 $-C_1-C_5$ 烷基、杂芳基 $-C_1-C_5$ 烷基、 C_3-C_{10} 环烷基 $-C_1-C_5$ 烷基、 C_5-C_{10} 环烯基 $-C_1-C_5$ 烷基、苯基 $-C_1-C_5$ 烷基和苯基,其中后提到的 10 个基团的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^y 。

[0117] 具体而言, R^N 若存在的话则选自 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 链烯基和 C_2-C_{10} 炔基,其中后提到的 3 个基团可以未被取代、可以被部分或完全卤代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^x , C_1-C_4 烷氧基 $-C_2-C_4$ 烷基、 C_1-C_4 亚烷基 $-CN$ 、杂环基、杂芳基、 C_3-C_{10} 环烷基、 C_5-C_{10} 环烯基、杂环基 $-C_1-C_5$ 烷基、杂芳基 $-C_1-C_5$ 烷基、 C_3-C_{10} 环烷基 $-C_1-C_5$ 烷基、 C_5-C_{10} 环烯基 $-C_1-C_5$ 烷基,其中后提到的 8 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^y 。

[0118] 具体而言, R^N 若存在的话则选自 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基 $-C_1-C_4$ 烷基,其中环烷基结构部分未被取代或者带有 1 或 2 个选自卤素、CN 和 C_1-C_2 卤代烷基的基团,杂环基 $-C_1-C_4$ 烷基、 C_1-C_4 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷基和 C_1-C_4 亚烷基 $-CN$ 。

[0119] 具体而言, R^N 若存在的话则选自 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_2 烷氧基 $-C_2-C_4$ 烷基、 C_1-C_4 亚烷基 $-CN$ 、 C_3-C_6 环烷基和 C_3-C_6 环烷基 $-C_1-C_4$ 烷基,其中后提到的 2 个基团中的环烷基结构部分未被取代或者带有 1 或 2 个选自卤素、CN 和 C_1-C_2 卤代烷基的基团。 R^N 尤其若存在的话则为 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 卤代烷基。

[0120] 本发明的非常优选实施方案涉及式 I 化合物、其盐及其 N-氧化物以及该类化合物的方法和用途,其中 A 为基团 A2 且剩余基团 R^1 和 X 如本文所定义。

[0121] 在涉及其中 A 为 A2 的式 I 化合物的实施方案中,特别优选的实施方案涉及其中 Z 为 NR^N 的化合物。

[0122] 在涉及其中 A 为 A2 的化合物的实施方案中,另一实施方案涉及其中 Z 为 O 的化合物。

[0123] 在涉及其中 A 为 A2 的化合物的实施方案中,另一实施方案涉及其中 Z 为 S 的化合物。

[0124] 在其中 A 为 A2 的式 I 化合物中,本发明的优选实施方案涉及如下式 I 化合物,其中 X 为 O 且 R^1 尤其具有优选含义之一。在该优选实施方案中,特别优选其中 n 为 1 的式 I

化合物。

[0125] 在其中 A 为 A2 的式 I 化合物中,另一实施方案涉及如下式 I 化合物,其中 X 为 O, R^1 具有优选含义之一且其中 n 为 2。

[0126] 在其中 A 为 A2 的式 I 化合物中,优选如下那些化合物,其中 R^A 若存在的话则选自卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基和 C₂-C₁₀ 链烯基,其中后提到的 2 个基团可以未被取代、可以部分或完全被卤代或者可以带有 1、2 或 3 个选自如下的相同或不同取代基: C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₃-C₆ 环烷基、杂芳基、苯基和苯氧基,其中后提到的 3 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基磺酰基和 C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基的基团,或者其中 R^A 进一步选自 C₃-C₆ 环烷基、C₅-C₆ 杂芳基和苯基,其中后提到的 3 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基磺酰基和 C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基的相同或不同取代基。

[0127] 在其中 A 为 A2 的式 I 化合物中,特别优选如下那些化合物,其中 R^A 选自卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 卤代环烷基和苯基,其中苯基可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的基团。更优选 R^A 选自卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基和 C₃-C₆ 卤代环烷基。 R^A 尤其选自氢、卤素、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基和 C₃-C₆ 卤代环烷基。 R^A 更具体为 C₁-C₂ 烷基或 C₁-C₂ 卤代烷基。

[0128] 在其中 A 为 A2 的式 I 化合物中,进一步优选如下那些化合物,其中 Z 为 N- R^N 且其中 R^N 选自 NO₂、C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 链烯基和 C₂-C₁₀ 炔基,其中后提到的 3 个基团可以未被取代、可以被部分或完全卤代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^X , 或者其中 R^N 进一步选自 OR^a、C(Y)R^b|C(Y)OR^c、S(O)_mR^d、NR^eR^f、C(Y)NR^gR^h、S(O)_mNR^eR^f、C(Y)NRⁱNR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -OR^a、C₁-C₅ 亚烷基 -CN、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)R^b、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)OR^c、C₁-C₅ 亚烷基 -NR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)NR^gR^h、C₁-C₅ 亚烷基 -S(O)_mR^d、C₁-C₅ 亚烷基 -S(O)_mNR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -NRⁱNR^eR^f、杂环基、杂芳基、C₃-C₁₀ 环烷基、C₅-C₁₀ 环烯基、杂环基 -C₁-C₅ 烷基、杂芳基 -C₁-C₅ 烷基、C₃-C₁₀ 环烷基 -C₁-C₅ 烷基、C₅-C₁₀ 环烯基 -C₁-C₅ 烷基、苯基 -C₁-C₅ 烷基和苯基,其中后提到的 10 个基团的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^Y 。

[0129] 在其中 A 为 A2 且 Z 为 N- R^N 的式 I 化合物中, R^N 更优选选自 C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 链烯基和 C₂-C₁₀ 炔基,其中后提到的 3 个基团可以未被取代、可以被部分或完全卤代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^X , C₁-C₄ 烷氧基 -C₂-C₄ 烷基、C₁-C₄ 亚烷基 -CN、杂环基、杂芳基、C₃-C₁₀ 环烷基、C₅-C₁₀ 环烯基、杂环基 -C₁-C₅ 烷基、杂芳基 -C₁-C₅ 烷基、C₃-C₁₀ 环烷基 -C₁-C₅ 烷基、C₅-C₁₀ 环烯基 -C₁-C₅ 烷基,其中后提到的 8 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^Y 。

[0130] 在其中 A 为 A2 且 Z 为 N- R^N 的化合物中, R^N 更优选选自 C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 环烷基 -C₁-C₄ 烷基,其中后提到的 2 个基团中的环烷基结构部分未被取代或者带有 1 或 2 个选自卤素、CN 和 C₁-C₂ 卤代烷基的基团,杂环基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基和 C₁-C₄ 亚烷基 -CN。

[0131] 具体而言, R^N 若存在的话则选自 C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₂ 烷氧基 -C₂-C₄ 烷

基、 C_1-C_4 亚烷基 $-CN$ 、 C_3-C_6 环烷基和 C_3-C_6 环烷基 $-C_1-C_4$ 烷基, 其中后提到的 2 个基团中的环烷基结构部分未被取代或者带有 1 或 2 个选自卤素、 CN 和 C_1-C_2 卤代烷基的基团。 R^N 尤其若存在的话则为 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 卤代烷基。

[0132] 合适基团 R^N 的实例如下表 R^N 中定义:

[0133] 表 R^N

[0134]

序号	R^N
R.N 1	H
R.N 2	CH_3
R.N 3	CH_2CH_3
R.N 4	$CH_2CH_2CH_3$
R.N 5	$CH(CH_3)_2$
R.N 6	CH_2CF_3
R.N 7	$C(CH_3)_3$
R.N 8	C_6H_5
R.N 9	4-Cl- C_6H_4
R.N 10	4-F- C_6H_4
R.N 11	2,4-Cl ₂ - C_6H_3
R.N 12	4-(CH_3O)- C_6H_4
R.N 13	2-吡啶基
R.N 14	5-Cl-2-吡啶基
R.N 15	$CH_2-C_6H_5$
R.N 16	4-(OCF_3)- C_6H_4
R.N 17	4-(SCF_3)- C_6H_4

序号	R^N
R.N 18	4-($OCHF_2$)- C_6H_4
R.N 19	4-($CF(CF_3)_2$)- C_6H_4
R.N 20	4-(SO_2CH_3)- C_6H_4
R.N 21	2,6-Cl-4- CF_3 - C_6H_2
R.N 22	3-Cl-5- CF_3 -吡啶-2-基
R.N 23	3-吡啶基
R.N 24	4-吡啶基
R.N 25	2-噻唑基
R.N 26	4,5-(CH_3) ₂ -噻唑-2-基
R.N 27	4-噻唑基
R.N 28	5-噻唑基
R.N 29	4- CF_3 -噻唑-2-基
R.N 30	4- CH_3 -噻唑-2-基
R.N 31	4- CH_3 -噻唑-2-基
R.N 32	5-三唑基
R.N 33	3- CH_3 -三唑-5-基

[0135]

序号	R ^N
R.N 34	CH ₂ (4-Cl-C ₆ H ₄)
R.N 35	4-NO ₂ -1-吡唑基-甲基
R.N 36	2-咪唑基
R.N 37	4-咪唑基
R.N 38	5-咪唑基
R.N 39	2-噁唑基
R.N 40	4-噁唑基
R.N 41	5-噁唑基
R.N 42	3-异噁唑基
R.N 43	4-异噁唑基
R.N 44	5-异噁唑基
R.N 45	3-CH ₃ -异噁唑-5-基
R.N 46	5-CH ₃ -异噁唑-3-基
R.N 47	3-吡唑基
R.N 48	[1,3,4]噻二唑-2-基
R.N 49	5-四唑基
R.N 50	4-NO ₂ -C ₆ H ₄
R.N 51	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
R.N 52	2,4-F ₂ -C ₆ H ₃
R.N 53	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
R.N 54	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
R.N 55	4-C(CH ₃) ₃ -C ₆ H ₄
R.N 56	3-Cl-C ₆ H ₄
R.N 57	3-F-C ₆ H ₄
R.N 58	2-F-C ₆ H ₄
R.N 59	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
R.N 60	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
R.N 61	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
R.N 62	3-Cl-4-F-C ₆ H ₃
R.N 63	3-NO ₂ -C ₆ H ₄
R.N 64	2-CH ₃ -C ₆ H ₄
R.N 65	3-CH ₃ -C ₆ H ₄
R.N 66	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
R.N 67	2-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄
R.N 68	3-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄
R.N 69	2-F-4-Cl-C ₆ H ₃
R.N 70	2,4,6-Cl ₃ -C ₆ H ₂
R.N 71	2,3,4-Cl ₃ -C ₆ H ₂
R.N 72	2,6-F ₂ -C ₆ H ₃
R.N 73	CH ₂ F
R.N 74	CHF ₂
R.N 75	CF ₃
R.N 76	CH ₂ CHF ₂
R.N 77	CH ₂ Cl
R.N 78	CHCl ₂
R.N 79	CCl ₃

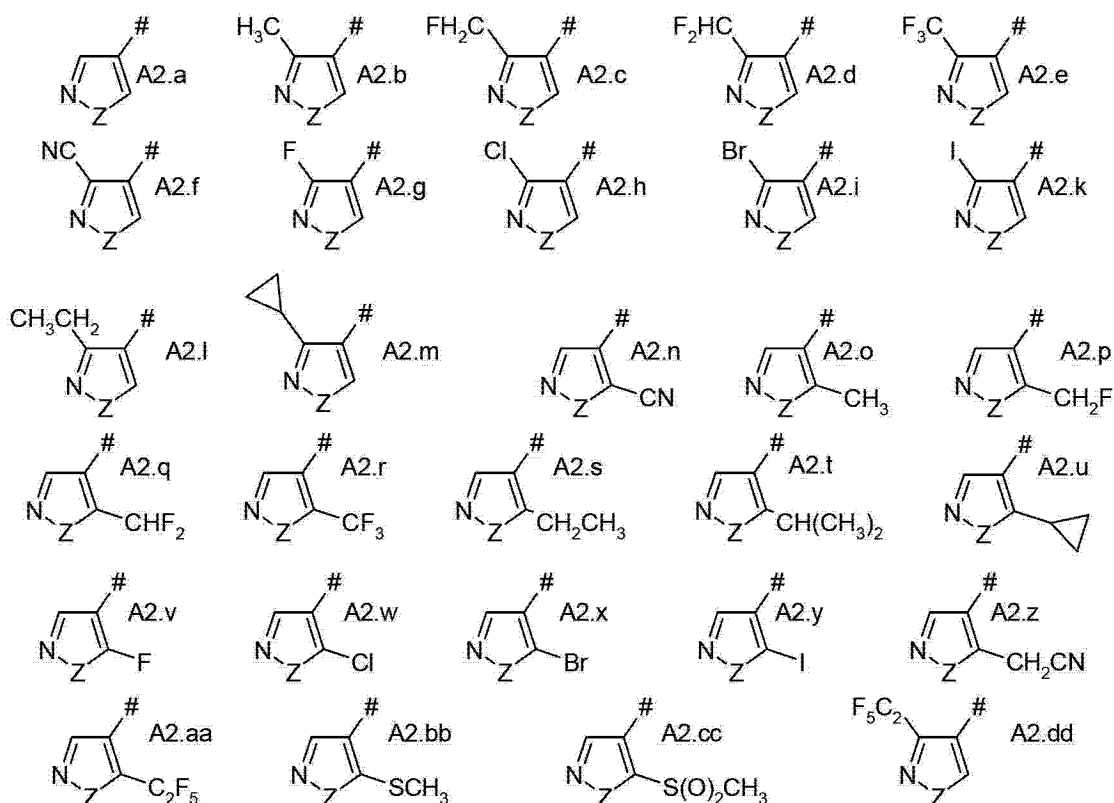
序号	R ^N
R.N 80	CH ₂ CHCl ₂
R.N 81	CH ₂ CCl ₃
R.N 82	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
R.N 83	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
R.N 84	CH ₂ CH ₂ CN
R.N 85	CH(CH ₃)CH ₂ CN
R.N 86	CH ₂ CH(CH ₃)CN
R.N 87	环丙基
R.N 88	1-F-环丙基
R.N 89	1-Cl-环丙基
R.N 90	环丙基甲基
R.N 91	1-F-环丙基甲基
R.N 92	1-Cl-环丙基甲基
R.N 93	1-CF ₃ -环丙基甲基
R.N 94	1-CN-环丙基甲基
R.N 95	2,2-Cl ₂ -环丙基甲基
R.N 96	2-NO ₂ -C ₆ H ₄
R.N 97	6-Cl-2-吡啶基
R.N 98	5-NO ₂ -2-吡啶基
R.N 99	3-NO ₂ -2-吡啶基
R.N 100	6-CH ₃ -5-NO ₂ -2-吡啶基
R.N 101	吡嗪-2-基
R.N 102	嘧啶-2-基
R.N 103	噻吩-3-基
R.N 104	4-CH ₃ -5-CH(CH ₃) ₂ -4H-[1,2,4]-三唑-3-基
R.N 105	4-CH ₃ -5-环丙基-4H-[1,2,4]-三唑-3-基
R.N 106	4-CH ₃ -5-CF ₃ -4H-[1,2,4]-三唑-3-基
R.N 107	4,5-(CH ₃) ₂ -4H-[1,2,4]-三唑-3-基
R.N 108	4-CH ₃ -5-C ₂ H ₅ -4H-[1,2,4]-三唑-3-基
R.N 109	4-CH(CH ₃) ₂ -4H-[1,2,4]-三唑-3-基
R.N 110	4-环丙基-4H-[1,2,4]-三唑-3-基
R.N 111	4-CH ₃ -4H-[1,2,4]-三唑-3-基
R.N 112	4-C ₂ H ₅ -4H-[1,2,4]-三唑-3-基
R.N 113	4-C ₆ H ₅ -4H-[1,2,4]-三唑-3-基
R.N 114	5-CH ₃ -1,3,4-噻二唑-2-基
R.N 115	CH=CH ₂
R.N 116	CH ₂ CH=CH ₂
R.N 117	5-C ₆ H ₅ -1,3,4-噻二唑-2-基
R.N 118	5-CF ₃ -1,3,4-噻二唑-2-基
R.N 119	5-C ₆ H ₅ -1,3,4-噁二唑-2-基
R.N 120	5-CF ₃ -1,3,4-噁二唑-2-基
R.N 121	5-CH ₃ -1,3,4-噁二唑-2-基
R.N 122	1-CH ₃ -1,2,3-三唑-4-基
R.N 123	1-C ₆ H ₅ -1,2,3-三唑-4-基

[0136] 本发明的实施方案涉及其中 A 选自基团 A2 的下列合适实例的式 I 化合物。

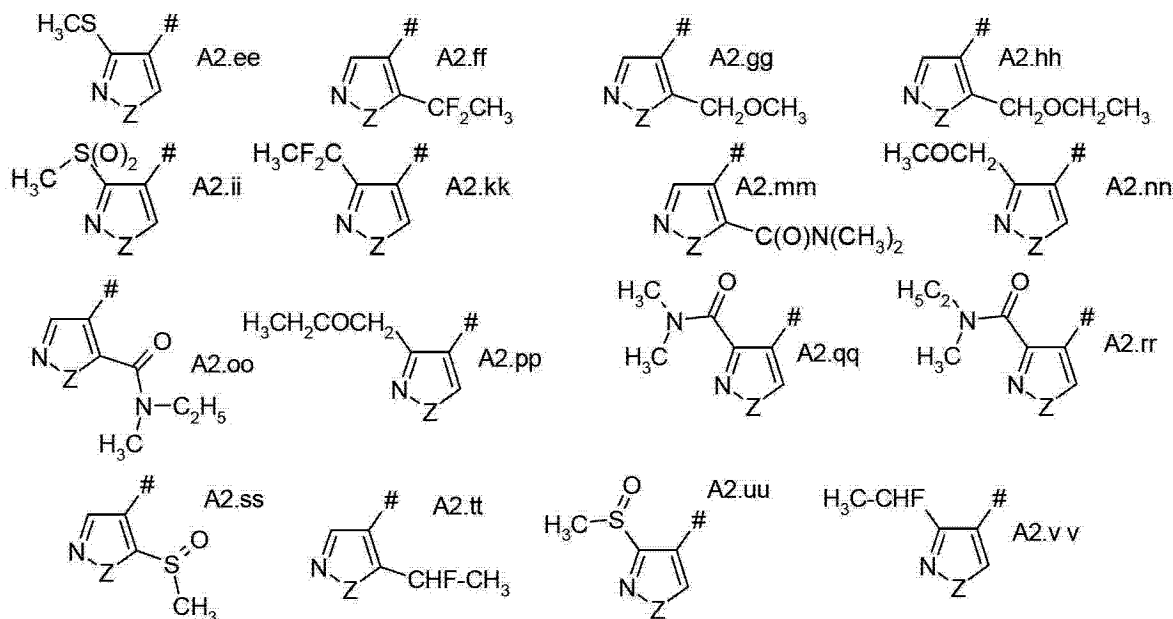
[0137] 下列实例的合适基团 A2 的各组构成本发明的实施方案。

[0138] 合适基团 A2 的实例是式 A2. a、A2. b、A2. c、A2. d、A2. e、A2. f、A2. g、A2. h、A2. i、A2. k、A2. l、A2. m、A2. n、A2. o、A2. p、A2. q、A2. r、A2. s、A2. t、A2. u、A2. v、A2. w、A2. x、A2. y、A2. z、A2. aa、A2. bb、A2. cc、A2. dd、A2. ee、A2. ff、A2. gg、A2. hh、A2. ii、A2. kk、A2. mm、A2. nn、A2. oo、A2. pp、A2. qq、A2. rr、A2. ss、A2. tt、A2. uu 和 A2. vv 的基团, 优选基团 A2. a、A2. b、A2. c、A2. d、A2. e、A2. f、A2. n、A2. o、A2. q、A2. r、A2. s、A2. t、A2. u、A2. v、A2. w、A2. x、A2. y、A2. z、A2. aa、A2. bb、A2. cc、A2. dd、A2. ee、A2. ff、A2. gg、A2. hh、A2. kk、A2. ss、A2. tt、A2. uu 和 A2. vv, 特别优选式 A2. o、A2. p、A2. r 和 A2. tt 的基团, 其中 Z 为 O 或 S 或 NR^{N} , 其中 R^{N} 如上面在涉及 R^{N} 的实施方案中所定义, 优选在表 R^{N} 的一行中所定义, 尤其如在 R. N 1-R. N 8、R. N 13、R. N 15、R. N 23、R. N 24、R. N 73-R. N 78 和 R. N 82-R. N 95 行中所定义。

[0139]



[0140]



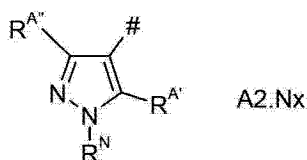
[0141] 类似于式 A2. a-A2. z 的基团的上述实例, 其他合适的基团 A2 是式 A20. a、A20. b、A20. c、A20. d、A20. e、A20. f、A20. g、A20. h、A20. i、A20. k、A20. l、A20. m、A20. n、A20. o、A20. p、A20. q、A20. r、A20. s、A20. t、A20. u、A20. v、A20. w、A20. x、A20. y、A20. z、A20. aa、A20. bb、A20. cc、A20. dd、A20. ee、A20. ff、A20. gg、A20. hh、A20. ii、A20. kk、A20. mm、A20. nn、A20. oo、A20. pp、A20. qq、A20. rr、A20. ss、A20. tt、A20. uu 和 A20. vv 的基团, 其中 Z 为 O。

[0142] 类似于式 A2. a-A2. z 的基团的上述实例, 其他合适的基团 A2 是式 A2S. a、A2S. b、A2S. c、A2S. d、A2S. e、A2S. f、A2S. g、A2S. h、A2S. i、A2S. k、A2S. l、A2S. m、A2S. n、A2S. o、A2S. p、A2S. q、A2S. r、A2S. s、A2S. t、A2S. u、A2S. v、A2S. w、A2S. x、A2S. y、A2S. z、A2S. aa、A2S. bb、A20. cc、A2S. dd、A2S. ee、A2S. ff、A2S. gg、A2S. hh、A2S. ii、A2S. kk、A2S. mm、A2S. nn、A2S. oo、A2S. pp、A2S. qq、A2S. rr、A2S. ss、A2S. tt、A2S. uu 和 A2S. vv 的基团, 其中 Z 为 S。

[0143] 特别优选的基团 A2 的实例是类型 A2. Nx. a、A2Nx. a、A2Nx. b、A2Nx. c、A2Nx. d、A2Nx. e、A2Nx. f、A2Nx. g、A2Nx. h、A2Nx. i、A2Nx. k、A2NX. l、A2Nx. m、A2NX. n、A2Nx. o、A2Nx. p、A2Nx. q、A2NX. r、A2NX. s、A2Nx. t、A2NX. u、A2Nx. v、A2NX. w、A2Nx. x、A2Nx. y、A2Nx. z、A2NX. aa、A2Nx. bb、A2Nx. cc、A2Nx. dd、A2Nx. ee、A2Nx. ff、A2Nx. gg、A2Nx. hh、A2Nx. ii、A2Nx. kk、A2Nx. mm、A2Nx. nn、A2Nx. oo、A2Nx. pp、A2Nx. qq、A2Nx. rr、A2Nx. ss、A2Nx. tt、A2Nx. uu 和 A2Nx. vv 的基团, 其中 Z 为 N-R^N 且其中 R^N 对应于表 R^N 的 1-123 行中所给含义之一。

[0144] 特别优选的基团 A2 是类型 A2. Nx 的基团：

[0145]



[0146] 其中 # 表示与式 I 化合物的剩余部分的连接点, R^N 如本文所定义, R^{A'} 为氢或具有对 R^A 所给含义之一并且其中 R^{A''} 为氢或具有对 R^A 所给含义之一。R^{A'} 特别为氢或具有 R^A 的优选含义之一。R^{A''} 尤其为氢或具有 R^A 的优选含义之一。

[0147] 特别优选的基团 A2 的实例是编号为 A2. N1-A2. N1014 的类型 A2. Nx 的基团, 其中

表示与式 I 化合物的剩余部分的连接点, R^N 、 $R^{A'}$ 和 $R^{A''}$ 如下表 A 的各行所示。

[0148] 表 A : 基团 A2. N...

[0149]

序号	R^N	$R^{A''}$	$R^{A'}$
1	H	H	H
2	H	H	CH ₃
3	H	H	C ₂ H ₅
4	H	H	C ₃ H ₇
5	H	H	CHF ₂
6	H	H	CF ₃
7	H	H	F
8	H	H	Cl
9	H	H	Br
10	H	H	I
11	H	H	cC ₃ H ₅
12	H	H	CN
13	H	H	CH ₂ CN
14	H	F	H
15	H	F	CH ₃
16	H	F	C ₂ H ₅
17	H	F	C ₃ H ₇
18	H	F	CHF ₂
19	H	F	CF ₃
20	H	F	F
21	H	F	Cl
22	H	F	Br

序号	R^N	$R^{A''}$	$R^{A'}$
23	H	F	I
24	H	F	cC ₃ H ₅
25	H	F	CN
26	H	F	CH ₂ CN
27	H	Cl	H
28	H	Cl	CH ₃
29	H	Cl	C ₂ H ₅
30	H	Cl	C ₃ H ₇
31	H	Cl	CHF ₂
32	H	Cl	CF ₃
33	H	Cl	F
34	H	Cl	Cl
35	H	Cl	Br
36	H	Cl	I
37	H	Cl	cC ₃ H ₅
38	H	Cl	CN
39	H	Cl	CH ₂ CN
40	CH ₃	H	H
41	CH ₃	H	CH ₃
42	CH ₃	H	C ₂ H ₅
43	CH ₃	H	C ₃ H ₇
44	CH ₃	H	CHF ₂

[0150]

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
45	CH ₃	H	CF ₃
46	CH ₃	H	F
47	CH ₃	H	Cl
48	CH ₃	H	Br
49	CH ₃	H	I
50	CH ₃	H	cC ₃ H ₅
51	CH ₃	H	CN
52	CH ₃	H	CH ₂ CN
53	CH ₃	F	H
54	CH ₃	F	CH ₃
55	CH ₃	F	C ₂ H ₅
56	CH ₃	F	C ₃ H ₇
57	CH ₃	F	CHF ₂
58	CH ₃	F	CF ₃
59	CH ₃	F	F
60	CH ₃	F	Cl
61	CH ₃	F	Br
62	CH ₃	F	I
63	CH ₃	F	cC ₃ H ₅
64	CH ₃	F	CN
65	CH ₃	F	CH ₂ CN
66	CH ₃	Cl	H
67	CH ₃	Cl	CH ₃
68	CH ₃	Cl	C ₂ H ₅
69	CH ₃	Cl	C ₃ H ₇
70	CH ₃	Cl	CHF ₂
71	CH ₃	Cl	CF ₃
72	CH ₃	Cl	F
73	CH ₃	Cl	Cl
74	CH ₃	Cl	Br
75	CH ₃	Cl	I
76	CH ₃	Cl	cC ₃ H ₅
77	CH ₃	Cl	CN
78	CH ₃	Cl	CH ₂ CN
79	CH ₂ CH ₃	H	H
80	CH ₂ CH ₃	H	CH ₃
81	CH ₂ CH ₃	H	C ₂ H ₅
82	CH ₂ CH ₃	H	C ₃ H ₇
83	CH ₂ CH ₃	H	CHF ₂
84	CH ₂ CH ₃	H	CF ₃
85	CH ₂ CH ₃	H	F
86	CH ₂ CH ₃	H	Cl
87	CH ₂ CH ₃	H	Br
88	CH ₂ CH ₃	H	I
89	CH ₂ CH ₃	H	cC ₃ H ₅
90	CH ₂ CH ₃	H	CN

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
91	CH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CN
92	CH ₂ CH ₃	F	H
93	CH ₂ CH ₃	F	CH ₃
94	CH ₂ CH ₃	F	C ₂ H ₅
95	CH ₂ CH ₃	F	C ₃ H ₇
96	CH ₂ CH ₃	F	CHF ₂
97	CH ₂ CH ₃	F	CF ₃
98	CH ₂ CH ₃	F	F
99	CH ₂ CH ₃	F	Cl
100	CH ₂ CH ₃	F	Br
101	CH ₂ CH ₃	F	I
102	CH ₂ CH ₃	F	cC ₃ H ₅
103	CH ₂ CH ₃	F	CN
104	CH ₂ CH ₃	F	CH ₂ CN
105	CH ₂ CH ₃	Cl	H
106	CH ₂ CH ₃	Cl	CH ₃
107	CH ₂ CH ₃	Cl	C ₂ H ₅
108	CH ₂ CH ₃	Cl	C ₃ H ₇
109	CH ₂ CH ₃	Cl	CHF ₂
110	CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃
111	CH ₂ CH ₃	Cl	F
112	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl
113	CH ₂ CH ₃	Cl	Br
114	CH ₂ CH ₃	Cl	I
115	CH ₂ CH ₃	Cl	cC ₃ H ₅
116	CH ₂ CH ₃	Cl	CN
117	CH ₂ CH ₃	Cl	CH ₂ CN
118	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H
119	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CH ₃
120	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	C ₂ H ₅
121	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	C ₃ H ₇
122	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CHF ₂
123	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃
124	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	F
125	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	Cl
126	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	Br
127	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	I
128	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	cC ₃ H ₅
129	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CN
130	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CN
131	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	H
132	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	CH ₃
133	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	C ₂ H ₅
134	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	C ₃ H ₇
135	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	CHF ₂
136	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	CF ₃

[0151]

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
137	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F
138	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	Cl
139	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	Br
140	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	I
141	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	cC ₃ H ₅
142	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	CN
143	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	CH ₂ CN
144	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	H
145	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CH ₃
146	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	C ₂ H ₅
147	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	C ₃ H ₇
148	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CHF ₂
149	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃
150	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	F
151	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	Cl
152	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	Br
153	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	I
154	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	cC ₃ H ₅
155	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CN
156	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CH ₂ CN
157	CH(CH ₃) ₂	H	H
158	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃
159	CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅
160	CH(CH ₃) ₂	H	C ₃ H ₇
161	CH(CH ₃) ₂	H	CHF ₂
162	CH(CH ₃) ₂	H	CF ₃
163	CH(CH ₃) ₂	H	F
164	CH(CH ₃) ₂	H	Cl
165	CH(CH ₃) ₂	H	Br
166	CH(CH ₃) ₂	H	I
167	CH(CH ₃) ₂	H	cC ₃ H ₅
168	CH(CH ₃) ₂	H	CN
169	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CN
170	CH(CH ₃) ₂	F	H
171	CH(CH ₃) ₂	F	CH ₃
172	CH(CH ₃) ₂	F	C ₂ H ₅
173	CH(CH ₃) ₂	F	C ₃ H ₇
174	CH(CH ₃) ₂	F	CHF ₂
175	CH(CH ₃) ₂	F	CF ₃
176	CH(CH ₃) ₂	F	F
177	CH(CH ₃) ₂	F	Cl
178	CH(CH ₃) ₂	F	Br
179	CH(CH ₃) ₂	F	I
180	CH(CH ₃) ₂	F	cC ₃ H ₅
181	CH(CH ₃) ₂	F	CN
182	CH(CH ₃) ₂	F	CH ₂ CN

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
183	CH(CH ₃) ₂	Cl	H
184	CH(CH ₃) ₂	Cl	CH ₃
185	CH(CH ₃) ₂	Cl	C ₂ H ₅
186	CH(CH ₃) ₂	Cl	C ₃ H ₇
187	CH(CH ₃) ₂	Cl	CHF ₂
188	CH(CH ₃) ₂	Cl	CF ₃
189	CH(CH ₃) ₂	Cl	F
190	CH(CH ₃) ₂	Cl	Cl
191	CH(CH ₃) ₂	Cl	Br
192	CH(CH ₃) ₂	Cl	I
193	CH(CH ₃) ₂	Cl	cC ₃ H ₅
194	CH(CH ₃) ₂	Cl	CN
195	CH(CH ₃) ₂	Cl	CH ₂ CN
196	CH ₂ CF ₃	H	H
197	CH ₂ CF ₃	H	CH ₃
198	CH ₂ CF ₃	H	C ₂ H ₅
199	CH ₂ CF ₃	H	C ₃ H ₇
200	CH ₂ CF ₃	H	CHF ₂
201	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃
202	CH ₂ CF ₃	H	F
203	CH ₂ CF ₃	H	Cl
204	CH ₂ CF ₃	H	Br
205	CH ₂ CF ₃	H	I
206	CH ₂ CF ₃	H	cC ₃ H ₅
207	CH ₂ CF ₃	H	CN
208	CH ₂ CF ₃	H	CH ₂ CN
209	CH ₂ CF ₃	F	H
210	CH ₂ CF ₃	F	CH ₃
211	CH ₂ CF ₃	F	C ₂ H ₅
212	CH ₂ CF ₃	F	C ₃ H ₇
213	CH ₂ CF ₃	F	CHF ₂
214	CH ₂ CF ₃	F	CF ₃
215	CH ₂ CF ₃	F	F
216	CH ₂ CF ₃	F	Cl
217	CH ₂ CF ₃	F	Br
218	CH ₂ CF ₃	F	I
219	CH ₂ CF ₃	F	cC ₃ H ₅
220	CH ₂ CF ₃	F	CN
221	CH ₂ CF ₃	F	CH ₂ CN
222	CH ₂ CF ₃	Cl	H
223	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₃
224	CH ₂ CF ₃	Cl	C ₂ H ₅
225	CH ₂ CF ₃	Cl	C ₃ H ₇
226	CH ₂ CF ₃	Cl	CHF ₂
227	CH ₂ CF ₃	Cl	CF ₃
228	CH ₂ CF ₃	Cl	F

[0152]

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
229	CH ₂ CF ₃	Cl	Cl
230	CH ₂ CF ₃	Cl	Br
231	CH ₂ CF ₃	Cl	I
232	CH ₂ CF ₃	Cl	cC ₃ H ₅
233	CH ₂ CF ₃	Cl	CN
234	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ CN
235	C(CH ₃) ₃	H	H
236	C(CH ₃) ₃	H	CH ₃
237	C(CH ₃) ₃	H	C ₂ H ₅
238	C(CH ₃) ₃	H	C ₃ H ₇
239	C(CH ₃) ₃	H	CHF ₂
240	C(CH ₃) ₃	H	CF ₃
241	C(CH ₃) ₃	H	F
242	C(CH ₃) ₃	H	Cl
243	C(CH ₃) ₃	H	Br
244	C(CH ₃) ₃	H	I
245	C(CH ₃) ₃	H	cC ₃ H ₅
246	C(CH ₃) ₃	H	CN
247	C(CH ₃) ₃	H	CH ₂ CN
248	C(CH ₃) ₃	F	H
249	C(CH ₃) ₃	F	CH ₃
250	C(CH ₃) ₃	F	C ₂ H ₅
251	C(CH ₃) ₃	F	C ₃ H ₇
252	C(CH ₃) ₃	F	CHF ₂
253	C(CH ₃) ₃	F	CF ₃
254	C(CH ₃) ₃	F	F
255	C(CH ₃) ₃	F	Cl
256	C(CH ₃) ₃	F	Br
257	C(CH ₃) ₃	F	I
258	C(CH ₃) ₃	F	cC ₃ H ₅
259	C(CH ₃) ₃	F	CN
260	C(CH ₃) ₃	F	CH ₂ CN
261	C(CH ₃) ₃	Cl	H
262	C(CH ₃) ₃	Cl	CH ₃
263	C(CH ₃) ₃	Cl	C ₂ H ₅
264	C(CH ₃) ₃	Cl	C ₃ H ₇
265	C(CH ₃) ₃	Cl	CHF ₂
266	C(CH ₃) ₃	Cl	CF ₃
267	C(CH ₃) ₃	Cl	F
268	C(CH ₃) ₃	Cl	Cl
269	C(CH ₃) ₃	Cl	Br
270	C(CH ₃) ₃	Cl	I
271	C(CH ₃) ₃	Cl	cC ₃ H ₅
272	C(CH ₃) ₃	Cl	CN
273	C(CH ₃) ₃	Cl	CH ₂ CN
274	CH ₂ F	H	H

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
275	CH ₂ F	H	CH ₃
276	CH ₂ F	H	C ₂ H ₅
277	CH ₂ F	H	C ₃ H ₇
278	CH ₂ F	H	CHF ₂
279	CH ₂ F	H	CF ₃
280	CH ₂ F	H	F
281	CH ₂ F	H	Cl
282	CH ₂ F	H	Br
283	CH ₂ F	H	I
284	CH ₂ F	H	cC ₃ H ₅
285	CH ₂ F	H	CN
286	CH ₂ F	H	CH ₂ CN
287	CH ₂ F	F	H
288	CH ₂ F	F	CH ₃
289	CH ₂ F	F	C ₂ H ₅
290	CH ₂ F	F	C ₃ H ₇
291	CH ₂ F	F	CHF ₂
292	CH ₂ F	F	CF ₃
293	CH ₂ F	F	F
294	CH ₂ F	F	Cl
295	CH ₂ F	F	Br
296	CH ₂ F	F	I
297	CH ₂ F	F	cC ₃ H ₅
298	CH ₂ F	F	CN
299	CH ₂ F	F	CH ₂ CN
300	CH ₂ F	Cl	H
301	CH ₂ F	Cl	CH ₃
302	CH ₂ F	Cl	C ₂ H ₅
303	CH ₂ F	Cl	C ₃ H ₇
304	CH ₂ F	Cl	CHF ₂
305	CH ₂ F	Cl	CF ₃
306	CH ₂ F	Cl	F
307	CH ₂ F	Cl	Cl
308	CH ₂ F	Cl	Br
309	CH ₂ F	Cl	I
310	CH ₂ F	Cl	cC ₃ H ₅
311	CH ₂ F	Cl	CN
312	CH ₂ F	Cl	CH ₂ CN
313	CHF ₂	H	H
314	CHF ₂	H	CH ₃
315	CHF ₂	H	C ₂ H ₅
316	CHF ₂	H	C ₃ H ₇
317	CHF ₂	H	CHF ₂
318	CHF ₂	H	CF ₃
319	CHF ₂	H	F
320	CHF ₂	H	Cl

[0153]

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
321	CHF ₂	H	Br
322	CHF ₂	H	I
323	CHF ₂	H	cC ₃ H ₅
324	CHF ₂	H	CN
325	CHF ₂	H	CH ₂ CN
326	CHF ₂	F	H
327	CHF ₂	F	CH ₃
328	CHF ₂	F	C ₂ H ₅
329	CHF ₂	F	C ₃ H ₇
330	CHF ₂	F	CHF ₂
331	CHF ₂	F	CF ₃
332	CHF ₂	F	F
333	CHF ₂	F	Cl
334	CHF ₂	F	Br
335	CHF ₂	F	I
336	CHF ₂	F	cC ₃ H ₅
337	CHF ₂	F	CN
338	CHF ₂	F	CH ₂ CN
339	CHF ₂	Cl	H
340	CHF ₂	Cl	CH ₃
341	CHF ₂	Cl	C ₂ H ₅
342	CHF ₂	Cl	C ₃ H ₇
343	CHF ₂	Cl	CHF ₂
344	CHF ₂	Cl	CF ₃
345	CHF ₂	Cl	F
346	CHF ₂	Cl	Cl
347	CHF ₂	Cl	Br
348	CHF ₂	Cl	I
349	CHF ₂	Cl	cC ₃ H ₅
350	CHF ₂	Cl	CN
351	CHF ₂	Cl	CH ₂ CN
352	CF ₃	H	H
353	CF ₃	H	CH ₃
354	CF ₃	H	C ₂ H ₅
355	CF ₃	H	C ₃ H ₇
356	CF ₃	H	CHF ₂
357	CF ₃	H	CF ₃
358	CF ₃	H	F
359	CF ₃	H	Cl
360	CF ₃	H	Br
361	CF ₃	H	I
362	CF ₃	H	cC ₃ H ₅
363	CF ₃	H	CN
364	CF ₃	H	CH ₂ CN
365	CF ₃	F	H
366	CF ₃	F	CH ₃

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
367	CF ₃	F	C ₂ H ₅
368	CF ₃	F	C ₃ H ₇
369	CF ₃	F	CHF ₂
370	CF ₃	F	CF ₃
371	CF ₃	F	F
372	CF ₃	F	Cl
373	CF ₃	F	Br
374	CF ₃	F	I
375	CF ₃	F	cC ₃ H ₅
376	CF ₃	F	CN
377	CF ₃	F	CH ₂ CN
378	CF ₃	Cl	H
379	CF ₃	Cl	CH ₃
380	CF ₃	Cl	C ₂ H ₅
381	CF ₃	Cl	C ₃ H ₇
382	CF ₃	Cl	CHF ₂
383	CF ₃	Cl	CF ₃
384	CF ₃	Cl	F
385	CF ₃	Cl	Cl
386	CF ₃	Cl	Br
387	CF ₃	Cl	I
388	CF ₃	Cl	cC ₃ H ₅
389	CF ₃	Cl	CN
390	CF ₃	Cl	CH ₂ CN
391	CH ₂ CHF ₂	H	H
392	CH ₂ CHF ₂	H	CH ₃
393	CH ₂ CHF ₂	H	C ₂ H ₅
394	CH ₂ CHF ₂	H	C ₃ H ₇
395	CH ₂ CHF ₂	H	CHF ₂
396	CH ₂ CHF ₂	H	CF ₃
397	CH ₂ CHF ₂	H	F
398	CH ₂ CHF ₂	H	Cl
399	CH ₂ CHF ₂	H	Br
400	CH ₂ CHF ₂	H	I
401	CH ₂ CHF ₂	H	cC ₃ H ₅
402	CH ₂ CHF ₂	H	CN
403	CH ₂ CHF ₂	H	CH ₂ CN
404	CH ₂ CHF ₂	F	H
405	CH ₂ CHF ₂	F	CH ₃
406	CH ₂ CHF ₂	F	C ₂ H ₅
407	CH ₂ CHF ₂	F	C ₃ H ₇
408	CH ₂ CHF ₂	F	CHF ₂
409	CH ₂ CHF ₂	F	CF ₃
410	CH ₂ CHF ₂	F	F
411	CH ₂ CHF ₂	F	Cl
412	CH ₂ CHF ₂	F	Br

[0154]

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
413	CH ₂ CHF ₂	F	I
414	CH ₂ CHF ₂	F	cC ₃ H ₅
415	CH ₂ CHF ₂	F	CN
416	CH ₂ CHF ₂	F	CH ₂ CN
417	CH ₂ CHF ₂	Cl	H
418	CH ₂ CHF ₂	Cl	CH ₃
419	CH ₂ CHF ₂	Cl	C ₂ H ₅
420	CH ₂ CHF ₂	Cl	C ₃ H ₇
421	CH ₂ CHF ₂	Cl	CHF ₂
422	CH ₂ CHF ₂	Cl	CF ₃
423	CH ₂ CHF ₂	Cl	F
424	CH ₂ CHF ₂	Cl	Cl
425	CH ₂ CHF ₂	Cl	Br
426	CH ₂ CHF ₂	Cl	I
427	CH ₂ CHF ₂	Cl	cC ₃ H ₅
428	CH ₂ CHF ₂	Cl	CN
429	CH ₂ CHF ₂	Cl	CH ₂ CN
430	CH ₂ Cl	H	H
431	CH ₂ Cl	H	CH ₃
432	CH ₂ Cl	H	C ₂ H ₅
433	CH ₂ Cl	H	C ₃ H ₇
434	CH ₂ Cl	H	CHF ₂
435	CH ₂ Cl	H	CF ₃
436	CH ₂ Cl	H	F
437	CH ₂ Cl	H	Cl
438	CH ₂ Cl	H	Br
439	CH ₂ Cl	H	I
440	CH ₂ Cl	H	cC ₃ H ₅
441	CH ₂ Cl	H	CN
442	CH ₂ Cl	H	CH ₂ CN
443	CH ₂ Cl	F	H
444	CH ₂ Cl	F	CH ₃
445	CH ₂ Cl	F	C ₂ H ₅
446	CH ₂ Cl	F	C ₃ H ₇
447	CH ₂ Cl	F	CHF ₂
448	CH ₂ Cl	F	CF ₃
449	CH ₂ Cl	F	F
450	CH ₂ Cl	F	Cl
451	CH ₂ Cl	F	Br
452	CH ₂ Cl	F	I
453	CH ₂ Cl	F	cC ₃ H ₅
454	CH ₂ Cl	F	CN
455	CH ₂ Cl	F	CH ₂ CN
456	CH ₂ Cl	Cl	H
457	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
458	CH ₂ Cl	Cl	C ₂ H ₅

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
459	CH ₂ Cl	Cl	C ₃ H ₇
460	CH ₂ Cl	Cl	CHF ₂
461	CH ₂ Cl	Cl	CF ₃
462	CH ₂ Cl	Cl	F
463	CH ₂ Cl	Cl	Cl
464	CH ₂ Cl	Cl	Br
465	CH ₂ Cl	Cl	I
466	CH ₂ Cl	Cl	cC ₃ H ₅
467	CH ₂ Cl	Cl	CN
468	CH ₂ Cl	Cl	CH ₂ CN
469	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H
470	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃
471	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅
472	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	C ₃ H ₇
473	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	CHF ₂
474	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	CF ₃
475	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	F
476	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	Cl
477	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	Br
478	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	I
479	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	cC ₃ H ₅
480	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	CN
481	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CN
482	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	F	H
483	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	F	CH ₃
484	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	F	C ₂ H ₅
485	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	F	C ₃ H ₇
486	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	F	CHF ₂
487	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	F	CF ₃
488	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	F	F
489	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	F	Cl
490	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	F	Br
491	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	F	I
492	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	F	cC ₃ H ₅
493	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	F	CN
494	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	F	CH ₂ CN
495	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	H
496	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	CH ₃
497	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	C ₂ H ₅
498	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	C ₃ H ₇
499	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	CHF ₂
500	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	CF ₃
501	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	F
502	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	Cl
503	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	Br
504	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	I

[0155]

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
505	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	cC ₃ H ₅
506	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	CN
507	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	CH ₂ CN
508	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H
509	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃
510	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	C ₂ H ₅
511	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	C ₃ H ₇
512	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CHF ₂
513	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CF ₃
514	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	F
515	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	Cl
516	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	Br
517	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	I
518	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	cC ₃ H ₅
519	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CN
520	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₂ CN
521	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	H
522	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	CH ₃
523	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	C ₂ H ₅
524	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	C ₃ H ₇
525	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	CHF ₂
526	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	CF ₃
527	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	F
528	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	Cl
529	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	Br
530	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	I
531	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	cC ₃ H ₅
532	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	CN
533	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	CH ₂ CN
534	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	H
535	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	CH ₃
536	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	C ₂ H ₅
537	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	C ₃ H ₇
538	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	CHF ₂
539	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	CF ₃
540	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	F
541	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	Cl
542	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	Br
543	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	I
544	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	cC ₃ H ₅
545	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	CN
546	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	CH ₂ CN
547	CH ₂ CH ₂ CN	H	H
548	CH ₂ CH ₂ CN	H	CH ₃
549	CH ₂ CH ₂ CN	H	C ₂ H ₅
550	CH ₂ CH ₂ CN	H	C ₃ H ₇

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
551	CH ₂ CH ₂ CN	H	CHF ₂
552	CH ₂ CH ₂ CN	H	CF ₃
553	CH ₂ CH ₂ CN	H	F
554	CH ₂ CH ₂ CN	H	Cl
555	CH ₂ CH ₂ CN	H	Br
556	CH ₂ CH ₂ CN	H	I
557	CH ₂ CH ₂ CN	H	cC ₃ H ₅
558	CH ₂ CH ₂ CN	H	CN
559	CH ₂ CH ₂ CN	H	CH ₂ CN
560	CH ₂ CH ₂ CN	F	H
561	CH ₂ CH ₂ CN	F	CH ₃
562	CH ₂ CH ₂ CN	F	C ₂ H ₅
563	CH ₂ CH ₂ CN	F	C ₃ H ₇
564	CH ₂ CH ₂ CN	F	CHF ₂
565	CH ₂ CH ₂ CN	F	CF ₃
566	CH ₂ CH ₂ CN	F	F
567	CH ₂ CH ₂ CN	F	Cl
568	CH ₂ CH ₂ CN	F	Br
569	CH ₂ CH ₂ CN	F	I
570	CH ₂ CH ₂ CN	F	cC ₃ H ₅
571	CH ₂ CH ₂ CN	F	CN
572	CH ₂ CH ₂ CN	F	CH ₂ CN
573	CH ₂ CH ₂ CN	Cl	H
574	CH ₂ CH ₂ CN	Cl	CH ₃
575	CH ₂ CH ₂ CN	Cl	C ₂ H ₅
576	CH ₂ CH ₂ CN	Cl	C ₃ H ₇
577	CH ₂ CH ₂ CN	Cl	CHF ₂
578	CH ₂ CH ₂ CN	Cl	CF ₃
579	CH ₂ CH ₂ CN	Cl	F
580	CH ₂ CH ₂ CN	Cl	Cl
581	CH ₂ CH ₂ CN	Cl	Br
582	CH ₂ CH ₂ CN	Cl	I
583	CH ₂ CH ₂ CN	Cl	cC ₃ H ₅
584	CH ₂ CH ₂ CN	Cl	CN
585	CH ₂ CH ₂ CN	Cl	CH ₂ CN
586	CH ₂ CH(CH ₃)CN	H	H
587	CH ₂ CH(CH ₃)CN	H	CH ₃
588	CH ₂ CH(CH ₃)CN	H	C ₂ H ₅
589	CH ₂ CH(CH ₃)CN	H	C ₃ H ₇
590	CH ₂ CH(CH ₃)CN	H	CHF ₂
591	CH ₂ CH(CH ₃)CN	H	CF ₃
592	CH ₂ CH(CH ₃)CN	H	F
593	CH ₂ CH(CH ₃)CN	H	Cl
594	CH ₂ CH(CH ₃)CN	H	Br
595	CH ₂ CH(CH ₃)CN	H	I
596	CH ₂ CH(CH ₃)CN	H	cC ₃ H ₅

[0156]

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
597	CH ₂ CH(CH ₃)CN	H	CN
598	CH ₂ CH(CH ₃)CN	H	CH ₂ CN
599	CH ₂ CH(CH ₃)CN	F	H
600	CH ₂ CH(CH ₃)CN	F	CH ₃
601	CH ₂ CH(CH ₃)CN	F	C ₂ H ₅
602	CH ₂ CH(CH ₃)CN	F	C ₃ H ₇
603	CH ₂ CH(CH ₃)CN	F	CHF ₂
604	CH ₂ CH(CH ₃)CN	F	CF ₃
605	CH ₂ CH(CH ₃)CN	F	F
606	CH ₂ CH(CH ₃)CN	F	Cl
607	CH ₂ CH(CH ₃)CN	F	Br
608	CH ₂ CH(CH ₃)CN	F	I
609	CH ₂ CH(CH ₃)CN	F	cC ₃ H ₅
610	CH ₂ CH(CH ₃)CN	F	CN
611	CH ₂ CH(CH ₃)CN	F	CH ₂ CN
612	CH ₂ CH(CH ₃)CN	Cl	H
613	CH ₂ CH(CH ₃)CN	Cl	CH ₃
614	CH ₂ CH(CH ₃)CN	Cl	C ₂ H ₅
615	CH ₂ CH(CH ₃)CN	Cl	C ₃ H ₇
616	CH ₂ CH(CH ₃)CN	Cl	CHF ₂
617	CH ₂ CH(CH ₃)CN	Cl	CF ₃
618	CH ₂ CH(CH ₃)CN	Cl	F
619	CH ₂ CH(CH ₃)CN	Cl	Cl
620	CH ₂ CH(CH ₃)CN	Cl	Br
621	CH ₂ CH(CH ₃)CN	Cl	I
622	CH ₂ CH(CH ₃)CN	Cl	cC ₃ H ₅
623	CH ₂ CH(CH ₃)CN	Cl	CN
624	CH ₂ CH(CH ₃)CN	Cl	CH ₂ CN
625	CH(CH ₃)CH ₂ CN	H	H
626	CH(CH ₃)CH ₂ CN	H	CH ₃
627	CH(CH ₃)CH ₂ CN	H	C ₂ H ₅
628	CH(CH ₃)CH ₂ CN	H	C ₃ H ₇
629	CH(CH ₃)CH ₂ CN	H	CHF ₂
630	CH(CH ₃)CH ₂ CN	H	CF ₃
631	CH(CH ₃)CH ₂ CN	H	F
632	CH(CH ₃)CH ₂ CN	H	Cl
633	CH(CH ₃)CH ₂ CN	H	Br
634	CH(CH ₃)CH ₂ CN	H	I
635	CH(CH ₃)CH ₂ CN	H	cC ₃ H ₅
636	CH(CH ₃)CH ₂ CN	H	CN
637	CH(CH ₃)CH ₂ CN	H	CH ₂ CN
638	CH(CH ₃)CH ₂ CN	F	H
639	CH(CH ₃)CH ₂ CN	F	CH ₃
640	CH(CH ₃)CH ₂ CN	F	C ₂ H ₅
641	CH(CH ₃)CH ₂ CN	F	C ₃ H ₇
642	CH(CH ₃)CH ₂ CN	F	CHF ₂

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
643	CH(CH ₃)CH ₂ CN	F	CF ₃
644	CH(CH ₃)CH ₂ CN	F	F
645	CH(CH ₃)CH ₂ CN	F	Cl
646	CH(CH ₃)CH ₂ CN	F	Br
647	CH(CH ₃)CH ₂ CN	F	I
648	CH(CH ₃)CH ₂ CN	F	cC ₃ H ₅
649	CH(CH ₃)CH ₂ CN	F	CN
650	CH(CH ₃)CH ₂ CN	F	CH ₂ CN
651	CH(CH ₃)CH ₂ CN	Cl	H
652	CH(CH ₃)CH ₂ CN	Cl	CH ₃
653	CH(CH ₃)CH ₂ CN	Cl	C ₂ H ₅
654	CH(CH ₃)CH ₂ CN	Cl	C ₃ H ₇
655	CH(CH ₃)CH ₂ CN	Cl	CHF ₂
656	CH(CH ₃)CH ₂ CN	Cl	CF ₃
657	CH(CH ₃)CH ₂ CN	Cl	F
658	CH(CH ₃)CH ₂ CN	Cl	Cl
659	CH(CH ₃)CH ₂ CN	Cl	Br
660	CH(CH ₃)CH ₂ CN	Cl	I
661	CH(CH ₃)CH ₂ CN	Cl	cC ₃ H ₅
662	CH(CH ₃)CH ₂ CN	Cl	CN
663	CH(CH ₃)CH ₂ CN	Cl	CH ₂ CN
664	cC ₃ H ₅	H	H
665	cC ₃ H ₅	H	CH ₃
666	cC ₃ H ₅	H	C ₂ H ₅
667	cC ₃ H ₅	H	C ₃ H ₇
668	cC ₃ H ₅	H	CHF ₂
669	cC ₃ H ₅	H	CF ₃
670	cC ₃ H ₅	H	F
671	cC ₃ H ₅	H	Cl
672	cC ₃ H ₅	H	Br
673	cC ₃ H ₅	H	I
674	cC ₃ H ₅	H	cC ₃ H ₅
675	cC ₃ H ₅	H	CN
676	cC ₃ H ₅	H	CH ₂ CN
677	cC ₃ H ₅	F	H
678	cC ₃ H ₅	F	CH ₃
679	cC ₃ H ₅	F	C ₂ H ₅
680	cC ₃ H ₅	F	C ₃ H ₇
681	cC ₃ H ₅	F	CHF ₂
682	cC ₃ H ₅	F	CF ₃
683	cC ₃ H ₅	F	F
684	cC ₃ H ₅	F	Cl
685	cC ₃ H ₅	F	Br
686	cC ₃ H ₅	F	I
687	cC ₃ H ₅	F	cC ₃ H ₅
688	cC ₃ H ₅	F	CN

[0157]

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
689	cC ₃ H ₅	F	CH ₂ CN
690	cC ₃ H ₅	Cl	H
691	cC ₃ H ₅	Cl	CH ₃
692	cC ₃ H ₅	Cl	C ₂ H ₅
693	cC ₃ H ₅	Cl	C ₃ H ₇
694	cC ₃ H ₅	Cl	CHF ₂
695	cC ₃ H ₅	Cl	CF ₃
696	cC ₃ H ₅	Cl	F
697	cC ₃ H ₅	Cl	Cl
698	cC ₃ H ₅	Cl	Br
699	cC ₃ H ₅	Cl	I
700	cC ₃ H ₅	Cl	cC ₃ H ₅
701	cC ₃ H ₅	Cl	CN
702	cC ₃ H ₅	Cl	CH ₂ CN
703	1-F-cC ₃ H ₄	H	H
704	1-F-cC ₃ H ₄	H	CH ₃
705	1-F-cC ₃ H ₄	H	C ₂ H ₅
706	1-F-cC ₃ H ₄	H	C ₃ H ₇
707	1-F-cC ₃ H ₄	H	CHF ₂
708	1-F-cC ₃ H ₄	H	CF ₃
709	1-F-cC ₃ H ₄	H	F
710	1-F-cC ₃ H ₄	H	Cl
711	1-F-cC ₃ H ₄	H	Br
712	1-F-cC ₃ H ₄	H	I
713	1-F-cC ₃ H ₄	H	cC ₃ H ₅
714	1-F-cC ₃ H ₄	H	CN
715	1-F-cC ₃ H ₄	H	CH ₂ CN
716	1-F-cC ₃ H ₄	F	H
717	1-F-cC ₃ H ₄	F	CH ₃
718	1-F-cC ₃ H ₄	F	C ₂ H ₅
719	1-F-cC ₃ H ₄	F	C ₃ H ₇
720	1-F-cC ₃ H ₄	F	CHF ₂
721	1-F-cC ₃ H ₄	F	CF ₃
722	1-F-cC ₃ H ₄	F	F
723	1-F-cC ₃ H ₄	F	Cl
724	1-F-cC ₃ H ₄	F	Br
725	1-F-cC ₃ H ₄	F	I
726	1-F-cC ₃ H ₄	F	cC ₃ H ₅
727	1-F-cC ₃ H ₄	F	CN
728	1-F-cC ₃ H ₄	F	CH ₂ CN
729	1-F-cC ₃ H ₄	Cl	H
730	1-F-cC ₃ H ₄	Cl	CH ₃
731	1-F-cC ₃ H ₄	Cl	C ₂ H ₅
732	1-F-cC ₃ H ₄	Cl	C ₃ H ₇
733	1-F-cC ₃ H ₄	Cl	CHF ₂
734	1-F-cC ₃ H ₄	Cl	CF ₃

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
735	1-F-cC ₃ H ₄	Cl	F
736	1-F-cC ₃ H ₄	Cl	Cl
737	1-F-cC ₃ H ₄	Cl	Br
738	1-F-cC ₃ H ₄	Cl	I
739	1-F-cC ₃ H ₄	Cl	cC ₃ H ₅
740	1-F-cC ₃ H ₄	Cl	CN
741	1-F-cC ₃ H ₄	Cl	CH ₂ CN
742	1-Cl-cC ₃ H ₄	H	H
743	1-Cl-cC ₃ H ₄	H	CH ₃
744	1-Cl-cC ₃ H ₄	H	C ₂ H ₅
745	1-Cl-cC ₃ H ₄	H	C ₃ H ₇
746	1-Cl-cC ₃ H ₄	H	CHF ₂
747	1-Cl-cC ₃ H ₄	H	CF ₃
748	1-Cl-cC ₃ H ₄	H	F
749	1-Cl-cC ₃ H ₄	H	Cl
750	1-Cl-cC ₃ H ₄	H	Br
751	1-Cl-cC ₃ H ₄	H	I
752	1-Cl-cC ₃ H ₄	H	cC ₃ H ₅
753	1-Cl-cC ₃ H ₄	H	CN
754	1-Cl-cC ₃ H ₄	H	CH ₂ CN
755	1-Cl-cC ₃ H ₄	F	H
756	1-Cl-cC ₃ H ₄	F	CH ₃
757	1-Cl-cC ₃ H ₄	F	C ₂ H ₅
758	1-Cl-cC ₃ H ₄	F	C ₃ H ₇
759	1-Cl-cC ₃ H ₄	F	CHF ₂
760	1-Cl-cC ₃ H ₄	F	CF ₃
761	1-Cl-cC ₃ H ₄	F	F
762	1-Cl-cC ₃ H ₄	F	Cl
763	1-Cl-cC ₃ H ₄	F	Br
764	1-Cl-cC ₃ H ₄	F	I
765	1-Cl-cC ₃ H ₄	F	cC ₃ H ₅
766	1-Cl-cC ₃ H ₄	F	CN
767	1-Cl-cC ₃ H ₄	F	CH ₂ CN
768	1-Cl-cC ₃ H ₄	Cl	H
769	1-Cl-cC ₃ H ₄	Cl	CH ₃
770	1-Cl-cC ₃ H ₄	Cl	C ₂ H ₅
771	1-Cl-cC ₃ H ₄	Cl	C ₃ H ₇
772	1-Cl-cC ₃ H ₄	Cl	CHF ₂
773	1-Cl-cC ₃ H ₄	Cl	CF ₃
774	1-Cl-cC ₃ H ₄	Cl	F
775	1-Cl-cC ₃ H ₄	Cl	Cl
776	1-Cl-cC ₃ H ₄	Cl	Br
777	1-Cl-cC ₃ H ₄	Cl	I
778	1-Cl-cC ₃ H ₄	Cl	cC ₃ H ₅
779	1-Cl-cC ₃ H ₄	Cl	CN
780	1-Cl-cC ₃ H ₄	Cl	CH ₂ CN

[0158]

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
781	CH ₂ cC ₃ H ₅	H	H
782	CH ₂ cC ₃ H ₅	H	CH ₃
783	CH ₂ cC ₃ H ₅	H	C ₂ H ₅
784	CH ₂ cC ₃ H ₅	H	C ₃ H ₇
785	CH ₂ cC ₃ H ₅	H	CHF ₂
786	CH ₂ cC ₃ H ₅	H	CF ₃
787	CH ₂ cC ₃ H ₅	H	F
788	CH ₂ cC ₃ H ₅	H	Cl
789	CH ₂ cC ₃ H ₅	H	Br
790	CH ₂ cC ₃ H ₅	H	I
791	CH ₂ cC ₃ H ₅	H	cC ₃ H ₅
792	CH ₂ cC ₃ H ₅	H	CN
793	CH ₂ cC ₃ H ₅	H	CH ₂ CN
794	CH ₂ cC ₃ H ₅	F	H
795	CH ₂ cC ₃ H ₅	F	CH ₃
796	CH ₂ cC ₃ H ₅	F	C ₂ H ₅
797	CH ₂ cC ₃ H ₅	F	C ₃ H ₇
798	CH ₂ cC ₃ H ₅	F	CHF ₂
799	CH ₂ cC ₃ H ₅	F	CF ₃
800	CH ₂ cC ₃ H ₅	F	F
801	CH ₂ cC ₃ H ₅	F	Cl
802	CH ₂ cC ₃ H ₅	F	Br
803	CH ₂ cC ₃ H ₅	F	I
804	CH ₂ cC ₃ H ₅	F	cC ₃ H ₅
805	CH ₂ cC ₃ H ₅	F	CN
806	CH ₂ cC ₃ H ₅	F	CH ₂ CN
807	CH ₂ cC ₃ H ₅	Cl	H
808	CH ₂ cC ₃ H ₅	Cl	CH ₃
809	CH ₂ cC ₃ H ₅	Cl	C ₂ H ₅
810	CH ₂ cC ₃ H ₅	Cl	C ₃ H ₇
811	CH ₂ cC ₃ H ₅	Cl	CHF ₂
812	CH ₂ cC ₃ H ₅	Cl	CF ₃
813	CH ₂ cC ₃ H ₅	Cl	F
814	CH ₂ cC ₃ H ₅	Cl	Cl
815	CH ₂ cC ₃ H ₅	Cl	Br
816	CH ₂ cC ₃ H ₅	Cl	I
817	CH ₂ cC ₃ H ₅	Cl	cC ₃ H ₅
818	CH ₂ cC ₃ H ₅	Cl	CN
819	CH ₂ cC ₃ H ₅	Cl	CH ₂ CN
820	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	H	H
821	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	H	CH ₃
822	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	H	C ₂ H ₅
823	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	H	C ₃ H ₇
824	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	H	CHF ₂
825	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	H	CF ₃
826	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	H	F

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
827	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	H	Cl
828	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	H	Br
829	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	H	I
830	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	H	cC ₃ H ₅
831	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	H	CN
832	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	H	CH ₂ CN
833	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	F	H
834	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	F	CH ₃
835	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	F	C ₂ H ₅
836	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	F	C ₃ H ₇
837	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	F	CHF ₂
838	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	F	CF ₃
839	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	F	F
840	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	F	Cl
841	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	F	Br
842	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	F	I
843	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	F	cC ₃ H ₅
844	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	F	CN
845	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	F	CH ₂ CN
846	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	Cl	H
847	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	Cl	CH ₃
848	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	Cl	C ₂ H ₅
849	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	Cl	C ₃ H ₇
850	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	Cl	CHF ₂
851	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	Cl	CF ₃
852	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	Cl	F
853	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	Cl	Cl
854	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	Cl	Br
855	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	Cl	I
856	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	Cl	cC ₃ H ₅
857	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	Cl	CN
858	CH ₂ (1-F-cC ₃ H ₄)	Cl	CH ₂ CN
859	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	H	H
860	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	H	CH ₃
861	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	H	C ₂ H ₅
862	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	H	C ₃ H ₇
863	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	H	CHF ₂
864	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	H	CF ₃
865	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	H	F
866	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	H	Cl
867	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	H	Br
868	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	H	I
869	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	H	cC ₃ H ₅
870	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	H	CN
871	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	H	CH ₂ CN
872	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	F	H

[0159]

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
873	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	F	CH ₃
874	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	F	C ₂ H ₅
875	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	F	C ₃ H ₇
876	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	F	CHF ₂
877	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	F	CF ₃
878	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	F	F
879	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	F	Cl
880	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	F	Br
881	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	F	I
882	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	F	cC ₃ H ₅
883	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	F	CN
884	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	F	CH ₂ CN
885	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	Cl	H
886	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	Cl	CH ₃
887	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	Cl	C ₂ H ₅
888	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	Cl	C ₃ H ₇
889	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	Cl	CHF ₂
890	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	Cl	CF ₃
891	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	Cl	F
892	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	Cl	Cl
893	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	Cl	Br
894	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	Cl	I
895	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	Cl	cC ₃ H ₅
896	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	Cl	CN
897	CH ₂ (1-Cl-cC ₃ H ₄)	Cl	CH ₂ CN
898	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	H	H
899	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	H	CH ₃
900	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	H	C ₂ H ₅
901	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	H	C ₃ H ₇
902	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	H	CHF ₂
903	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	H	CF ₃
904	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	H	F
905	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	H	Cl
906	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	H	Br
907	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	H	I
908	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	H	cC ₃ H ₅
909	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	H	CN
910	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	H	CH ₂ CN
911	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	F	H
912	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	F	CH ₃
913	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	F	C ₂ H ₅
914	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	F	C ₃ H ₇
915	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	F	CHF ₂
916	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	F	CF ₃
917	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	F	F
918	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	F	Cl

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
919	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	F	Br
920	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	F	I
921	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	F	cC ₃ H ₅
922	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	F	CN
923	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	F	CH ₂ CN
924	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	Cl	H
925	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	Cl	CH ₃
926	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	Cl	C ₂ H ₅
927	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	Cl	C ₃ H ₇
928	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	Cl	CHF ₂
929	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	Cl	CF ₃
930	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	Cl	F
931	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	Cl	Cl
932	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	Cl	Br
933	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	Cl	I
934	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	Cl	cC ₃ H ₅
935	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	Cl	CN
936	CH ₂ (1-CF ₃ -cC ₃ H ₄)	Cl	CH ₂ CN
937	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	H	H
938	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	H	CH ₃
939	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	H	C ₂ H ₅
940	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	H	C ₃ H ₇
941	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	H	CHF ₂
942	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	H	CF ₃
943	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	H	F
944	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	H	Cl
945	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	H	Br
946	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	H	I
947	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	H	cC ₃ H ₅
948	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	H	CN
949	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	H	CH ₂ CN
950	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	F	H
951	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	F	CH ₃
952	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	F	C ₂ H ₅
953	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	F	C ₃ H ₇
954	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	F	CHF ₂
955	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	F	CF ₃
956	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	F	F
957	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	F	Cl
958	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	F	Br
959	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	F	I
960	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	F	cC ₃ H ₅
961	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	F	CN
962	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	F	CH ₂ CN
963	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	Cl	H
964	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	Cl	CH ₃

[0160]

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
965	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	Cl	C ₂ H ₅
966	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	Cl	C ₃ H ₇
967	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	Cl	CHF ₂
968	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	Cl	CF ₃
969	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	Cl	F
970	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	Cl	Cl
971	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	Cl	Br
972	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	Cl	I
973	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	Cl	cC ₃ H ₅
974	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	Cl	CN
975	CH ₂ (1-CN-cC ₃ H ₄)	Cl	CH ₂ CN
976	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	H	H
977	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	H	CH ₃
978	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	H	C ₂ H ₅
979	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	H	C ₃ H ₇
980	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	H	CHF ₂
981	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	H	CF ₃
982	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	H	F
983	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	H	Cl
984	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	H	Br
985	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	H	I
986	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	H	cC ₃ H ₅
987	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	H	CN
988	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	H	CH ₂ CN
989	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	F	H
990	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	F	CH ₃
991	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	F	C ₂ H ₅
992	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	F	C ₃ H ₇
993	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	F	CHF ₂
994	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	F	CF ₃
995	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	F	F
996	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	F	Cl
997	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	F	Br
998	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	F	I
999	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	F	cC ₃ H ₅
1000	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	F	CN
1001	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	F	CH ₂ CN
1002	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	Cl	H
1003	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	Cl	CH ₃
1004	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	Cl	C ₂ H ₅
1005	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	Cl	C ₃ H ₇
1006	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	Cl	CHF ₂
1007	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	Cl	CF ₃
1008	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	Cl	F
1009	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	Cl	Cl
1010	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	Cl	Br

序号	R ^N	R ^{A''}	R ^{A'}
1011	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	Cl	I
1012	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	Cl	cC ₃ H ₅
1013	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	Cl	CN
1014	CH ₂ (2,2-Cl ₂ -cC ₃ H ₃)	Cl	CH ₂ CN

[0161] C₃H₇= 正丙基 cC₃H₅= 环丙基

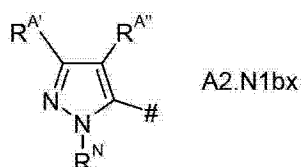
[0162] 发明的非常优选实施方案涉及如下的式 I 化合物,尤其是式 I1 化合物,其中 A 为表 A 所列优选基团 A2 之一。

[0163] 表 A 的各单独行构成本发明的优选基团 A2。

[0164] 在表 A 所列那组基团 A2 中,非常优选的子组涉及其中表 A 中的 $R^{A''}$ 为 H 的基团 A2。

[0165] 优选的基团 A2 也为类型 A2.N1bx 的基团:

[0166]

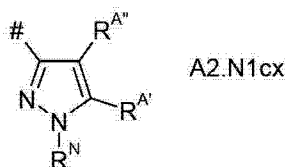


[0167] 其中 # 表示与式 I 化合物的剩余部分的连接点, R^N 如本文所定义, $R^{A'}$ 为氢或具有对 R^A 所给含义之一并且其中 $R^{A''}$ 为氢或具有对 R^A 所给含义之一。 $R^{A'}$ 尤其为氢或具有 R^A 的优选含义之一。 $R^{A''}$ 尤其为氢或具有 R^A 的优选含义之一。

[0168] 基团 A2.N1bx 的实例是编号为 A2.N1b1-A2.N1b1014 的类型 A2.N1bx 的基团, 其中 # 表示与式 I 化合物的剩余部分的连接点, R^N 、 $R^{A'}$ 和 $R^{A''}$ 如上表 A 的各行所示。

[0169] 优选的基团 A2 也为类型 A2.N1cx 的基团:

[0170]

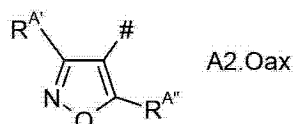
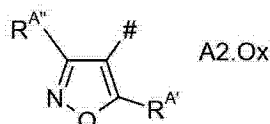


[0171] 其中 # 表示与式 I 化合物的剩余部分的连接点, R^N 如本文所定义, $R^{A'}$ 为氢或具有对 R^A 所给含义之一并且其中 $R^{A''}$ 为氢或具有对 R^A 所给含义之一。 $R^{A'}$ 尤其为氢或具有 R^A 的优选含义之一。 $R^{A''}$ 尤其为氢或具有 R^A 的优选含义之一。

[0172] 基团 A2.N1cx 的实例是编号为 A2.N1c1-A2.N1c1014 的类型 A2.N1cx 的基团, 其中 # 表示与式 I 化合物的剩余部分的连接点, R^N 、 $R^{A'}$ 和 $R^{A''}$ 如上表 A 的各行所示。

[0173] 基团 A2 的特别实施方案还分别为类型 A2.Ox 和 A2.Oax 的基团, 其中 # 表示与式 I 化合物的剩余部分的连接点, $R^{A'}$ 为氢或具有对 R^A 所给含义之一并且其中 $R^{A''}$ 为氢或具有对 R^A 所给含义之一。 $R^{A'}$ 尤其为氢或具有 R^A 的优选含义之一。 $R^{A''}$ 尤其为氢或具有 R^A 的优选含义之一。

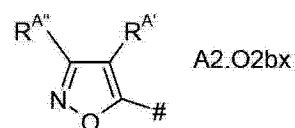
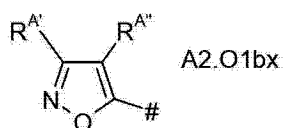
[0174]



[0175] 基团 A2.Ox 和 A2.Oax 的实例分别为基团 A2.O1-A2.O169 和 A2.Oa1-A2.Oa169, 其中 # 表示与式 I 化合物的剩余部分的连接点, $R^{A'}$ 和 $R^{A''}$ 如下表 R^A 的各行所示:

[0176] 基团 A2 的特殊实施方案还分别为类型 A2.O1bx 和 A2.O2bx 的基团, 其中 # 表示与式 I 化合物的剩余部分的连接点, $R^{A'}$ 为氢或具有对 R^A 所给含义之一并且其中 $R^{A''}$ 为氢或具有对 R^A 所给含义之一。 $R^{A'}$ 尤其为氢或具有 R^A 的优选含义之一。 $R^{A''}$ 尤其为氢或具有 R^A 的优选含义之一。

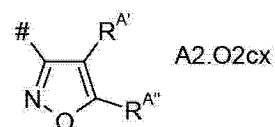
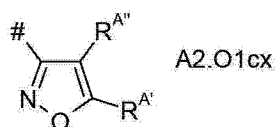
[0177]



[0178] 类型 A2.O1bx 和 A2.O2bx 的基团实例分别为基团 A2.O1b1-A2.O1b169 和 A2.O2b1-A2.O2b169, 其中 # 表示与式 I 化合物的剩余部分的连接点, $R^{A'}$ 和 $R^{A''}$ 如下表 R^A 的各行所示:

[0179] 基团 A2 的特殊实施方案还分别为类型 A2.O1cx 和 A2.O2cx 的基团, 其中 # 表示与式 I 化合物的剩余部分的连接点, $R^{A'}$ 为氢或具有对 R^A 所给含义之一并且其中 $R^{A''}$ 为氢或具有对 R^A 所给含义之一。 $R^{A'}$ 尤其为氢或具有 R^A 的优选含义之一。 $R^{A''}$ 尤其为氢或具有 R^A 的优选含义之一。

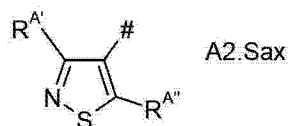
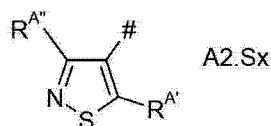
[0180]



[0181] 类型 A2.O1cx 和 A2.O2cx 的基团实例分别为基团 A2.O1c1-A2.O1b169 和 A2.O2c1-A2.O2c169, 其中 # 表示与式 I 化合物的剩余部分的连接点, $R^{A'}$ 和 $R^{A''}$ 如下表 R^A 的各行所示。

[0182] 基团 A2 的特殊实施方案还分别为类型 A2.Sx 和 A2.Sax 的基团, 其中 # 表示与式 I 化合物的剩余部分的连接点, $R^{A'}$ 为氢或具有对 R^A 所给含义之一并且其中 $R^{A''}$ 为氢或具有对 R^A 所给含义之一。 $R^{A'}$ 尤其为氢或具有 R^A 的优选含义之一。 $R^{A''}$ 尤其为氢或具有 R^A 的优选含义之一。

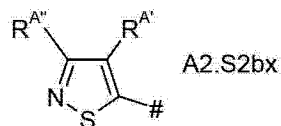
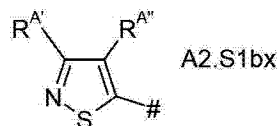
[0183]



[0184] 类型 A2.Sx 和 A2.Sax 的基团实例分别为基团 A2.S1-A2.S169 和 A2.Sa1-A2.Sa169, 其中 # 表示与式 I 化合物的剩余部分的连接点, $R^{A'}$ 和 $R^{A''}$ 如下表 R^A 的各行所示。

[0185] 基团 A2 的特殊实施方案还分别为类型 A2.S1bx 和 A2.S2bx 的基团, 其中 # 表示与式 I 化合物的剩余部分的连接点, $R^{A'}$ 为氢或具有对 R^A 所给含义之一并且其中 $R^{A''}$ 为氢或具有对 R^A 所给含义之一。 $R^{A'}$ 尤其为氢或具有 R^A 的优选含义之一。 $R^{A''}$ 尤其为氢或具有 R^A 的优选含义之一。

[0186]

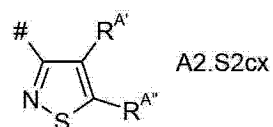
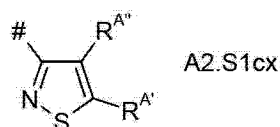


[0187] 类型 A2.S1bx 和 A2.S2bx 的基团实例分别为基团 A2.S1b1-A2.S1b169 和 A2.S2b1-A2.S2b169, 其中 # 表示与式 I 化合物的剩余部分的连接点, $R^{A'}$ 和 $R^{A''}$ 如下表 R^A 的各行所示。

[0188] 基团 A2 的特殊实施方案还分别为类型 A2.S1cx 和 A2.S2cx 的基团, 其中 # 表示与

式 I 化合物的剩余部分的连接点, $R^{A'}$ 为氢或具有对 R^A 所给含义之一并且其中 $R^{A''}$ 为氢或具有对 R^A 所给含义之一。 $R^{A'}$ 尤其为氢或具有 R^A 的优选含义之一。 $R^{A''}$ 尤其为氢或具有 R^A 的优选含义之一。

[0189]



[0190] 类型 A2.S1cx 和 A2.S2cx 的基团实例分别编号为 A2.S1c1-A2.S1c169 和 A2.S2c1-A2.S2c169, 其中 # 表示与式 I 化合物的剩余部分的连接点, $R^{A'}$ 和 $R^{A''}$ 如下表 R^A 的各行所示:

[0191] 表 R^A

[0192]

行	$R^{A'}$	$R^{A''}$
1	H	H
2	CH ₃	H
3	CH ₂ CH ₃	H
4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
5	CHF ₂	H
6	CF ₃	H

行	$R^{A'}$	$R^{A''}$
7	F	H
8	Cl	H
9	Br	H
10	I	H
11	cC ₃ H ₅	H
12	CN	H

[0193]

行	R ^{A'}	R ^{A''}
13	CH ₂ CN	H
14	H	CH ₃
15	CH ₃	CH ₃
16	CH ₂ CH ₃	CH ₃
17	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
18	CHF ₂	CH ₃
19	CF ₃	CH ₃
20	F	CH ₃
21	Cl	CH ₃
22	Br	CH ₃
23	I	CH ₃
24	cC ₃ H ₅	CH ₃
25	CN	CH ₃
26	CH ₂ CN	CH ₃
27	H	CH ₂ CH ₃
28	CH ₃	CH ₂ CH ₃
29	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
30	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
31	CHF ₂	CH ₂ CH ₃
32	CF ₃	CH ₂ CH ₃
33	F	CH ₂ CH ₃
34	Cl	CH ₂ CH ₃
35	Br	CH ₂ CH ₃
36	I	CH ₂ CH ₃
37	cC ₃ H ₅	CH ₂ CH ₃
38	CN	CH ₂ CH ₃
39	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃
40	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃
41	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
42	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
43	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
44	CHF ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
45	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
46	F	CH ₂ CH ₂ CH ₃
47	Cl	CH ₂ CH ₂ CH ₃
48	Br	CH ₂ CH ₂ CH ₃
49	I	CH ₂ CH ₂ CH ₃
50	cC ₃ H ₅	CH ₂ CH ₂ CH ₃
51	CN	CH ₂ CH ₂ CH ₃
52	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₂ CH ₃
53	H	CHF ₂

行	R ^{A'}	R ^{A''}
54	CH ₃	CHF ₂
55	CH ₂ CH ₃	CHF ₂
56	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CHF ₂
57	CHF ₂	CHF ₂
58	CF ₃	CHF ₂
59	F	CHF ₂
60	Cl	CHF ₂
61	Br	CHF ₂
62	I	CHF ₂
63	cC ₃ H ₅	CHF ₂
64	CN	CHF ₂
65	CH ₂ CN	CHF ₂
66	H	CF ₃
67	CH ₃	CF ₃
68	CH ₂ CH ₃	CF ₃
69	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃
70	CHF ₂	CF ₃
71	CF ₃	CF ₃
72	F	CF ₃
73	Cl	CF ₃
74	Br	CF ₃
75	I	CF ₃
76	cC ₃ H ₅	CF ₃
77	CN	CF ₃
78	CH ₂ CN	CF ₃
79	H	F
80	CH ₃	F
81	CH ₂ CH ₃	F
82	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F
83	CHF ₂	F
84	CF ₃	F
85	F	F
86	Cl	F
87	Br	F
88	I	F
89	cC ₃ H ₅	F
90	CN	F
91	CH ₂ CN	F
92	H	Cl
93	CH ₃	Cl
94	CH ₂ CH ₃	Cl

[0194]

行	R ^{A'}	R ^{A''}
95	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl
96	CHF ₂	Cl
97	CF ₃	Cl
98	F	Cl
99	Cl	Cl
100	Br	Cl
101	I	Cl
102	cC ₃ H ₅	Cl
103	CN	Cl
104	CH ₂ CN	Cl
105	H	Br
106	CH ₃	Br
107	CH ₂ CH ₃	Br
108	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Br
109	CHF ₂	Br
110	CF ₃	Br
111	F	Br
112	Cl	Br
113	Br	Br
114	I	Br
115	cC ₃ H ₅	Br
116	CN	Br
117	CH ₂ CN	Br
118	H	I
119	CH ₃	I
120	CH ₂ CH ₃	I
121	CH ₂ CH ₂ CH ₃	I
122	CHF ₂	I
123	CF ₃	I
124	F	I
125	Cl	I
126	Br	I
127	I	I
128	cC ₃ H ₅	I
129	CN	I
130	CH ₂ CN	I
131	H	cC ₃ H ₅
132	CH ₃	cC ₃ H ₅

行	R ^{A'}	R ^{A''}
133	CH ₂ CH ₃	cC ₃ H ₅
134	CH ₂ CH ₂ CH ₃	cC ₃ H ₅
135	CHF ₂	cC ₃ H ₅
136	CF ₃	cC ₃ H ₅
137	F	cC ₃ H ₅
138	Cl	cC ₃ H ₅
139	Br	cC ₃ H ₅
140	I	cC ₃ H ₅
141	cC ₃ H ₅	cC ₃ H ₅
142	CN	cC ₃ H ₅
143	CH ₂ CN	cC ₃ H ₅
144	H	CN
145	CH ₃	CN
146	CH ₂ CH ₃	CN
147	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CN
148	CHF ₂	CN
149	CF ₃	CN
150	F	CN
151	Cl	CN
152	Br	CN
153	I	CN
154	cC ₃ H ₅	CN
155	CN	CN
156	CH ₂ CN	CN
157	H	CH ₂ CN
158	CH ₃	CH ₂ CN
159	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CN
160	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CN
161	CHF ₂	CH ₂ CN
162	CF ₃	CH ₂ CN
163	F	CH ₂ CN
164	Cl	CH ₂ CN
165	Br	CH ₂ CN
166	I	CH ₂ CN
167	cC ₃ H ₅	CH ₂ CN
168	CN	CH ₂ CN
169	CH ₂ CN	CH ₂ CN

[0195] cC₃H₅= 环丙基

[0196] 本发明的另一实施方案涉及其中 A 为基团 A1 的式 I 化合物、其盐和 N- 氧化物以及该类化合物的方法和用途。

[0197] 本发明的实施方案涉及其中 A 为基团 A1 且剩余基团 R^1 和 X 在这里如上文所定义的式 I 的杂芳基（硫代）羧酰胺化合物、其 N-氧化物和互变异构体及其盐以及该类化合物的方法和用途。

[0198] 在涉及其中 A 为 A1 的式 I 化合物的实施方案中，特别优选的实施方案涉及其中 Z 为 NR^N 的化合物。在该实施方案中， R^N 优选具有上面就基团 A2 所给优选含义或特别优选含义之一，尤其是表 R^N 的 1-123 行中所给含义之一。

[0199] 在涉及其中 A 为 A1 的化合物的实施方案中，另一实施方案涉及其中 Z 为 O 的化合物。

[0200] 在涉及其中 A 为 A1 的化合物的实施方案中，另一实施方案涉及其中 Z 为 S 的化合物。

[0201] 另一实施方案涉及如下式 I 化合物，其中 A 为 A1，其中 X 为 O 且 R^1 尤其具有本文所定义的优选含义之一。

[0202] 在该优选实施方案中，特别优选其中 n 为 1 的式 I 化合物。

[0203] 在其中 A 为 A1 的式 I 化合物中，另一实施方案涉及如下式 I 化合物，其中 X 为 O， R^1 具有本文所定义的优选含义之一且其中 n 为 2。

[0204] 在其中 A 为 A1 的式 I 化合物中，优选如下那些化合物，其中 R^A 具有如在其中 A 为 A2 的不同实施方案中所定义的含义。

[0205] 本发明的实施方案涉及其中 A 选自基团 A1 的下列合适实例的式 I 化合物。

[0206] 本发明的另一实施方案涉及其中 A 为基团 A3 的式 I 化合物、其盐和 N-氧化物以及该类化合物的方法和用途。

[0207] 本发明的实施方案涉及其中 A 为基团 A3 且剩余基团 R^1 和 X 在这里如上文所定义的式 I 的杂芳基（硫代）羧酰胺化合物、其盐、其互变异构体和 N-氧化物及其盐以及该类化合物的方法和用途。

[0208] 在涉及其中 A 为 A3 的式 I 化合物的实施方案中，特别优选的实施方案涉及其中 Z 为 NR^N 的化合物。

[0209] 在涉及其中 A 为 A3 的化合物的实施方案中，另一实施方案涉及其中 Z 为 O 的化合物。

[0210] 在涉及其中 A 为 A3 的化合物的实施方案中，另一实施方案涉及其中 Z 为 S 的化合物。

[0211] 另一实施方案涉及如下式 I 化合物，其中 A 为 A3，其中 X 为 O 且 R^1 尤其具有本文所定义的优选含义之一。

[0212] 在该优选实施方案中，特别优选其中 n 为 1 的式 I 化合物。

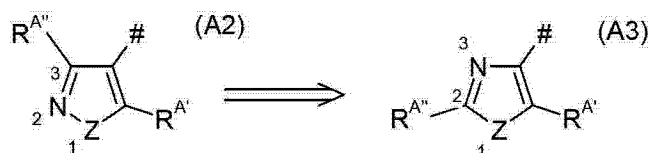
[0213] 在其中 A 为 A3 的式 I 化合物中，另一实施方案涉及如下式 I 化合物，其中 X 为 O， R^1 具有本文所定义的优选含义之一且其中 n 为 2。

[0214] 在其中 A 为 A3 的式 I 化合物中，优选如下那些化合物，其中 R^A 具有如在其中 A 为 A2 的不同实施方案中所定义的含义。

[0215] 基团 A3 的合适实例的各组构成本发明的实施方案。

[0216] 为清楚起见，当在基团 A2 和基团 A3 之间类似时，这应指在基团 A2 中 2 位的 N 原子如下列说明性方案所示与该基团中 3 位的取代基交换：

[0217]



对于结构类似性, 就基团 A2 和 A3 而言仅在 2 和 3 位的含义交换

[0218] 类似于式 A2. a-A2. z 和 A2. aa-A2. tt 的上述基团, 合适基团 A3 的实例是式 A3. a、A3. b、A3. c、A3. d、A3. e、A3. f、A3. g、A3. h、A3. i、A3. k、A3. l、A3. m、A3. n、A3. o、A3. p、A3. q、A3. r、A3. s、A3. t、A3. u、A3. v、A3. w、A3. x、A3. y、A3. z、A3. aa、A3. bb、A3. cc、A3. dd、A3. ee、A3. ff、A3. gg、A3. hh、A3. ii、A3. kk、A3. mm、A3. nn、A3. oo、A3. pp、A3. qq、A3. rr、A3. ss、A3. tt、A3. uu 和 A3. vv 的基团, 这些结构类似于上述式 A2. a-A2. z 和 A2. aa-A2. vv 的基团的结构且其中 Z 为 NR^{N} , 其中 R^{N} 优选如上面在涉及 R^{N} 的实施方案中所定义并且其中 R^{N} 例如为表 R^{N} 的一行中所定义的基团 (基团 A3. a1-A3. a123 至 A3. z1-A3. z123 和 A3. aa123-A3. vv123)。

[0219] 类似于式 A20. a-A20. z 和 A20. aa-A20. tt 的上述基团, 其他合适的基团 A3 为式 A30. a、A30. b、A30. c、A30. d、A30. e、A30. f、A30. g、A30. h、A30. i、A30. k、A30. l、A30. m、A30. n、A30. o、A30. p、A30. q、A30. r、A30. s、A30. t、A30. u、A30. v、A30. w、A30. x、A30. y、A30. z、A30. aa、A30. bb、A30. cc、A30. dd、A30. ee、A30. ff、A30. gg、A30. hh、A30. ii、A30. kk、A30. mm、A30. nn、A30. oo、A30. pp、A30. qq、A30. rr、A30. ss、A30. tt、A30. uu 和 A30. vv 的基团, 这些结构类似于上述式 A20. a-A20. z 和 A20. aa-A20. vv 的基团的结构且其中 Z 为 O。

[0220] 类似于式 A2S. a-A2S. z 和 A2S. aa-A2S. tt 的上述基团, 其他合适的基团 A3 为式 A3S. a、A3S. b、A3S. c、A3S. d、A3S. e、A3S. f、A3S. g、A3S. h、A3S. i、A3S. k、A3S. l、A3S. m、A3S. n、A3S. o、A3S. p、A3S. q、A3S. r、A3S. s、A3S. t、A3S. u、A3S. v、A3S. w、A3S. x、A3S. y、A3S. z、A3S. aa、A3S. bb、A3S. cc、A3S. dd、A3S. ee、A3S. ff、A3S. gg、A3S. hh、A3S. ii、A3S. kk、A3S. mm、A3S. nn、A3S. oo、A3S. pp、A3S. qq、A3S. rr、A3S. ss、A3S. tt、A3S. uu 和 A3S. vv 的基团, 这些结构类似于上述式 A2S. a-A2S. z 和 A2S. aa-A2S. vv 的基团的结构且其中 Z 为 S。

[0221] 特别优选式 A3. a、A3. b、A3. c、A3. d、A3. e、A3. f、A3. n、A3. o、A3. q、A3. r、A3. s、A3. t、A3. u、A3. v、A3. w、A3. x、A3. y 和 A3. z 的基团。

[0222] 非常特别优选式 A3. n、A3. o、A3. q、A3. r、A3. s、A3. t、A3. u、A3. v、A3. w、A3. x、A3. y 和 A3. z 的基团。

[0223] 还特别优选式 A3. aa、A3. bb、A3. cc、A3. dd、A3. ee、A3. ff、A3. gg、A3. hh、A3. kk、A3. ss、A3. tt、A3. uu 和 A3. vv 的基团。

[0224] 本发明的实施方案涉及其中 A 为式 A4、A5、A6 或 A7 的基团且剩余基团 R^1 和 X 在这里如上文所定义的式 I 化合物、其盐和 N-氧化物以及该类化合物的方法和用途。

[0225] 在涉及其中 A 为式 A4、A5、A6 或 A7 的基团的式 I 化合物的实施方案中, 特别优选的实施方案涉及其中 Z 为 NR^{N} 的化合物。

[0226] 在涉及其中 A 为式 A4、A5、A6 或 A7 的基团的式 I 化合物的实施方案中, 另一实施方案涉及其中 Z 为 O 的化合物。

[0227] 在涉及其中 A 为式 A4、A5、A6 或 A7 的基团的式 I 化合物的实施方案中, 另一实施方案涉及其中 Z 为 S 的化合物。

[0228] 另一实施方案涉及如下式 I 化合物, 其中 A 为式 A4、A5、A6 或 A7 的基团, 其中 X 为 O 且 R¹ 尤其具有本文所定义的优选含义之一。

[0229] 在该实施方案中, 特别优选其中 n 为 1 的式 I 化合物。

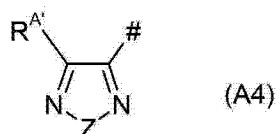
[0230] 在其中 A 为式 A4、A5、A6 或 A7 的基团的式 I 化合物中, 优选其中 R^A 具有如在其中 A 为 A2 的不同实施方案中所定义的含义。

[0231] 本发明的实施方案涉及其中 A 选自基团 A4、A5、A6 或 A7 的下列合适实例的式 I 化合物。

[0232] 基团 A4、A5、A6 或 A7 的合适实例的各组构成本发明的实施方案。

[0233] 本发明的特殊实施方案涉及如下式 I 化合物、其盐和 N-氧化物, 其中基团 A 为式 A4 的基团:

[0234]



[0235] 其中 # 表示与式 I 的剩余部分的连接点且 R^{A'} 如本文所定义。基团 A4 的实例是如下那些, 其中 R^{A'} 具有表 R^A 的 1-13 行的含义之一且其中 Z 为 NR^N, 其中 R^N 优选如上面在涉及 R^N 的实施方案中所定义, 以及其中 R^N 例如为如表 R^N 的一行中所定义的基团。

[0236] 类似于合适基团 A4 的上述实例, 其他合适的基团 A4 是其中 Z 为 O 的基团。

[0237] 类似于合适基团 A4 的上述实例, 其他合适的基团 A4 是其中 Z 为 S 的基团。

[0238] 本发明的特殊实施方案涉及如下式 I 化合物、其盐和 N-氧化物, 其中基团 A 为式 A5 的基团:

[0239]



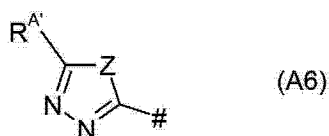
[0240] 其中 # 表示与式 I 的剩余部分的连接点且 R^{A'} 如本文所定义。基团 A5 的实例为如下那些, 其中 R^{A'} 具有表 R^A 的 1-13 行的各含义且其中 Z 为 NR^N, 其中 R^N 优选如上面在涉及 R^N 的实施方案中所定义, 以及其中 R^N 例如为如表 R^N 的一行中所定义的基团。

[0241] 类似于合适基团 A5 的上述实例, 其他合适的基团 A5 是其中 Z 为 O 的基团。

[0242] 类似于合适基团 A5 的上述实例, 其他合适的基团 A5 是其中 Z 为 S 的基团。

[0243] 本发明的特殊实施方案涉及如下式 I 化合物、其盐和 N-氧化物, 其中基团 A 为式 A6 的基团:

[0244]



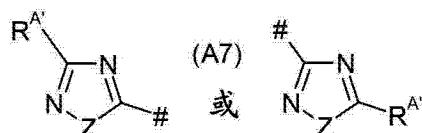
[0245] 其中 # 表示与式 I 的剩余部分的连接点且其中 Z 和 R^{A'} 如本文所定义。基团 A6 的实例为如下那些, 其中 R^{A'} 具有表 R^A 的 1-13 行的含义之一且其中 Z 为 NR^N, 其中 R^N 优选如上面在涉及 R^N 的实施方案中所定义, 以及其中 R^N 例如为如表 R^N 的一行中所定义的基团。

[0246] 类似于合适基团 A6 的上述实例,其他合适的基团 A6 是其中 Z 为 O 的基团。

[0247] 类似于合适基团 A6 的上述实例,其他合适的基团 A6 是其中 Z 为 S 的基团。

[0248] 本发明的特殊实施方案涉及如下式 I 化合物、其盐和 N-氧化物,其中基团 A 为式 A7 的基团:

[0249]



[0250] 其中 # 表示与式 I 的剩余部分的连接点且其中 Z 和 $R^{A'}$ 如本文所定义。基团 A7 的实例为如下那些,其中 $R^{A'}$ 具有表 R^A 的 1-13 行的含义之一且其中 Z 为 NR^N ,其中 R^N 优选如上面在涉及 R^N 的实施方案中所定义,以及其中 R^N 例如为如表 R^N 的一行中所定义的基团。

[0251] 类似于合适基团 A7 的上述实例,其他合适的基团 A7 是其中 Z 为 O 的基团。

[0252] 类似于合适基团 A7 的上述实例,其他合适的基团 A7 是其中 Z 为 S 的基团。

[0253] 本发明的另一实施方案涉及如下式 I 化合物、其盐及其 N-氧化物以及该类化合物的方法和用途,其中 A 为基团 A8:

[0254]



[0255] 其中 # 表示与式 I 的剩余部分的连接点,

[0256] Z^1 为 N 或 $C-R^{Z1}$;

[0257] Z^2 为 N 或 $C-R^{Z2}$;

[0258] Z^3 为 N 或 $C-R^{Z3}$;

[0259] Z^4 为 N 或 $C-R^{Z4}$;

[0260] Z^5 为 N 或 $C-R^{Z5}$;

[0261] 条件是变量 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 Z^4 或 Z^5 中的一个或两个为 N;

[0262] R^{Z1} 、 R^{Z5} 相互独立地选自氢、卤素、 CN 、 NO_2 、 OR^{a1} 、 $C(Y)R^{b1}$ 、 $S(O)_mR^{d1}$,其中 m 为 0、1 或 2, C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 炔基,其中后提到的 3 个基团可以未被取代或者可以部分或完全被卤代, C_1 - C_5 亚烷基 $-CN$ 、 C_1 - C_5 亚烷基 $-OR^a$ 、 C_1 - C_5 亚烷基 $-C(Y)R^b$ 、 C_1 - C_5 亚烷基 $-C(Y)OR^c$ 、 C_3 - C_{10} 环烷基 $-C_1$ - C_5 烷基、 C_5 - C_{10} 环烯基 $-C_1$ - C_5 烷基、3-10 员杂环基 $-C_1$ - C_5 烷基、饱和或不饱和 3-10 员杂环基、 C_3 - C_{10} 环烷基和 C_5 - C_{10} 环烯基,其中后提到的 6 个基团中的环烷基、环烯基和杂环基可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^y ;

[0263] R^{Z2} 、 R^{Z4} 相互独立地选自氢、卤素、 CN 、 NO_2 、 OR^{a2} 、 $C(Y)R^{b2}$ 、 $S(O)_mR^{d2}$,其中 m 为 0、1 或 2, C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 链烯基、 C_2 - C_{10} 炔基,其中后提到的 3 个基团可以未被取代或者可以部分或完全被卤代, C_1 - C_5 亚烷基 $-CN$ 、 C_1 - C_5 亚烷基 $-OR^a$ 、 C_1 - C_5 亚烷基 $-C(Y)R^b$ 、 C_1 - C_5 亚烷基 $-C(Y)OR^c$ 、 C_3 - C_{10} 环烷基 $-C_1$ - C_5 烷基、 C_5 - C_{10} 环烯基 $-C_1$ - C_5 烷基、3-10 员杂环基 $-C_1$ - C_5 烷基、饱和 3-10 员杂环基、 C_3 - C_{10} 环烷基和 C_5 - C_{10} 环烯基,其中后提到的 6 个基团中的环烷基、环烯基和杂环基可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^y ;

[0264] R^{Z3} 选自氢、卤素、 CN 、 NO_2 、 OR^{a3} 、 $C(Y)R^{b3}$ 、 $S(O)_mR^{d3}$,其中 m 为 0、1 或 2, C_1 - C_{10} 烷基、

C₂-C₁₀ 链烯基、C₂-C₁₀ 炔基,其中后提到的 3 个基团可以未被取代或者可以部分或完全被卤代, C₁-C₅ 亚烷基 -CN、C₁-C₅ 亚烷基 -OR^a、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)R^b、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)OR^c、C₃-C₁₀ 环烷基 -C₁-C₅ 烷基、C₅-C₁₀ 环烯基 -C₁-C₅ 烷基、3-10 员杂环基 -C₁-C₅ 烷基、饱和 3-10 员杂环基、C₃-C₁₀ 环烷基和 C₅-C₁₀ 环烯基,其中后提到的 6 个基团中的环烷基、环烯基和杂环基可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^y;

[0265] 其中 Y、R^y、R^a、R^b 和 R^c 如本文所定义且尤其具有所述含义之一,以及

[0266] 其中

[0267] R^{a1}、R^{a2} 相互独立地选自 C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 环烷基甲基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 炔基和 C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基;

[0268] R^{b1}、R^{b2} 相互独立地选自氢、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 环烷基甲基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 炔基和 C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基;

[0269] R^{d1}、R^{d2} 选自 C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 环烷基甲基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基 -C₁-C₄ 烷基、杂芳基 -C₁-C₄ 烷基和杂环基 -C₁-C₄ 烷基,其中后提到的 6 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的取代基;

[0270] R^{a3} 具有对 R^a 所给含义之一,氢除外;

[0271] R^{b3} 具有对 R^b 所给含义之一;以及

[0272] R^{d3} 具有对 R^d 所给含义之一。

[0273] 本发明的实施方案涉及如下式 I 的杂芳基(硫代)羧酰胺化合物、其盐、其互变异构体和 N-氧化物及其盐以及该类化合物的方法和用途,其中 A 为基团 A8,其优选为嘧啶基,以及剩余基团 R¹ 和 X 在这里如上文所定义。

[0274] 特殊实施方案涉及如下式 I 化合物,其中 A 为 A8,其中 X 为 O 且 R¹ 尤其具有本文所定义的优选含义之一。

[0275] 在其中 A 为 A8 的式 I 化合物中,优选如下那些化合物,其中 R^a 具有如在其中 A 为 A2 的不同实施方案中所定义的含义。

[0276] 在其中 A 为 A8 的式 I 化合物中,进一步优选如下那些化合物,其中变量 Z¹、Z²、Z³、Z⁴ 或 Z⁵ 的基团 A1 或 2 的杂环为 N 且剩余基团为 C-R^{Z1}、C-R^{Z2}、C-R^{Z3}、C-R^{Z4} 或 C-R^{Z5}。该类化合物的实例是如下式 I 或 II 化合物,其中杂环 A 选自基团吡嗪 -2- 基、哒嗪 -3- 基、哒嗪 -4- 基、嘧啶 -5- 基、嘧啶 -4- 基、嘧啶 -2- 基、1,2,3- 三嗪 -4- 基、1,2,3- 三嗪 -5- 基、1,2,4- 三嗪 -3- 基、1,2,4- 三嗪 -5- 基和 1,2,4- 三嗪 -6- 基,其中这些基团被变量 R^{Z1}、R^{Z2}、R^{Z3}、R^{Z4} 和 R^{Z5} 在其相应碳原子上取代。优选杂环 A 表示嘧啶 -5- 基结构部分。

[0277] 在其中 A 为 A8 的式 I 化合物中,进一步优选如下那些化合物,其中 R^{Z1} 和 R^{Z5} 若存在的话则不同于基团 SR^{d1} 并且其中 R^{Z1} 和 R^{Z5} 优选相互独立地选自氢、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基亚磺酰基、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-C₅ 亚烷基 -CN、C₁-C₅ 亚烷基 -OR^a、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)R^b 和 C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)OR^c、C₃-C₁₀ 环烷基、C₅-C₁₀ 环烯基、饱和或不饱和 3-10

员杂环基、C₃-C₁₀ 环烷基 -C₁-C₅ 烷基、C₅-C₁₀ 环烯基 -C₁-C₅ 烷基、3-10 员杂环基 -C₁-C₅ 烷基，其中后提到的 6 个基团中的环烷基、环烯基和杂环基可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^y，其中 Y 如本文所定义且尤其为氧，其中 R^a、R^b 和 R^c 如本文所定义且尤其相互独立地选自氢、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、杂环基 -C₁-C₄ 烷基和杂芳基 -C₁-C₄ 烷基，更优选选自氢、C₁-C₄ 烷基和 C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₂ 烷基，最优选选自氢、甲基和乙基，并且其中取代基 R^y 如本文所定义且尤其相互独立地选自卤素、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基磺酰基和 C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基。

[0278] 更优选 R^{Z1} 和 R^{Z5} 若存在的话则相互独立地选自氢、卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₃ 亚烷基 -CN、C₁-C₃ 亚烷基 -OR^a、C₃-C₇ 环烷基、C₃-C₇ 环烷基 -C₁-C₃ 烷基和 3-7 员饱和杂环基 -C₁-C₃ 烷基，其中后提到的 3 个基团中的环烷基和杂环基可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^y，其中 R^a 如本文所定义且尤其选自氢、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基和 C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₂ 烷基，具体选自氢、甲基、乙基、二氟甲基和三氟甲基，并且其中取代基 R^y 如本文所定义且尤其相互独立地选自卤素、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基磺酰基和 C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基。

[0279] 在本发明的特别优选实施方案中，R^{Z1} 和 R^{Z5} 若存在的话则相互独立地选自氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、环丙基、异丁基、环丙基甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、1- 氟乙基、2- 氟乙基、2, 2, 2- 三氟乙基、甲氧基甲基、二氟甲氧基甲基、三氟甲氧基甲基、氰基甲基、2- 甲氧基 -1- 乙基、2- 二氟甲氧基 -1- 乙基、2- 三氟甲氧基 -1- 乙基和 2- 氰基 -1- 乙基。

[0280] 在式 I 化合物中，进一步优选如下那些化合物，其中 R^{Z2} 和 R^{Z4} 若存在的话则相互独立地选自氢、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₄ 卤代烷硫基、C₁-C₄ 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-C₅ 亚烷基 -CN、C₁-C₅ 亚烷基 -OR^a、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)R^b、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)OR^c、C₃-C₁₀ 环烷基、C₅-C₁₀ 环烯基、饱和或部分不饱和 3-10 员杂环基、C₃-C₁₀ 环烷基 -C₁-C₅ 烷基、C₅-C₁₀ 环烯基 -C₁-C₅ 烷基、饱和或部分不饱和 3-10 员杂环基 -C₁-C₅ 烷基，其中后提到的 6 个基团中的环烷基、环烯基和杂环基可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^y，其中 Y 如本文所定义且尤其为氧，其中 R^a、R^b 和 R^c 如本文所定义且尤其相互独立地选自氢、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、杂环基 -C₁-C₄ 烷基和杂芳基 -C₁-C₄ 烷基，更优选选自氢、C₁-C₄ 烷基和 C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₂ 烷基，最优选选自氢、甲基和乙基，并且其中取代基 R^y 如本文所定义且尤其相互独立地选自卤素、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基磺酰基和 C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基。

[0281] 更优选 R^{Z2} 和 R^{Z4} 若存在的话则相互独立地选自氢、卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₃ 亚烷基 -CN、C₁-C₃ 亚烷基 -OR^a、C₃-C₇ 环烷基、C₃-C₇ 环烷基 -C₁-C₃ 烷基和 3-7 员饱和杂环基 -C₁-C₃ 烷基，其中后提到的 3 个基团中的环烷基和杂环基可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^y，其中 R^a 如本文所定义且尤其选自氢、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基和 C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₂ 烷基，具体选自氢、

甲基、乙基、二氟甲基和三氟甲基,并且其中取代基 R^y 如本文所定义且尤其相互独立地选自卤素、 NO_2 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基磺酰基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基磺酰基。

[0282] 在本发明的特别优选实施方案中, R^{Z2} 和 R^{Z4} 若存在的话则相互独立地选自氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、环丙基、异丁基、环丙基甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2,2-三氟乙基、甲氧基甲基、二氟甲氧基甲基、三氟甲氧基甲基、氰基甲基、2-甲氧基-1-乙基、2-二氟甲氧基-1-乙基、2-三氟甲氧基-1-乙基和 2-氰基-1-乙基。

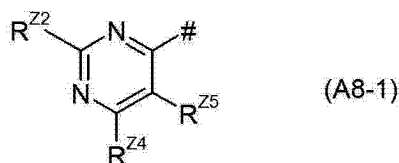
[0283] 在式 I 化合物中,进一步优选如下那些化合物,其中 R^{Z3} 若存在的话则选自氢、卤素、 CN 、 NO_2 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷硫基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷硫基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基亚磺酰基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基亚磺酰基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基磺酰基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基磺酰基、 $\text{C}_1\text{-C}_5$ 亚烷基- CN 、 $\text{C}_1\text{-C}_5$ 亚烷基- OR^a 、 $\text{C}_1\text{-C}_5$ 亚烷基- $\text{C}(\text{Y})\text{R}^b$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_5$ 亚烷基- $\text{C}(\text{Y})\text{OR}^c$ 、 $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ 环烷基、 $\text{C}_5\text{-C}_{10}$ 环烯基、饱和或部分不饱和 3-10 员杂环基、 $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ 环烷基- $\text{C}_1\text{-C}_5$ 烷基、 $\text{C}_5\text{-C}_{10}$ 环烯基- $\text{C}_1\text{-C}_5$ 烷基和 3-10 员杂环基- $\text{C}_1\text{-C}_5$ 烷基,其中后提到的 6 个基团中的环烷基、环烯基和杂环基可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^y ,其中 Y 如本文所定义且尤其为氧,其中 R^a 、 R^b 和 R^c 如本文所定义且尤其相互独立地选自氢、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、杂环基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基和杂芳基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基,更优选选自氢、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基,最优选选自氢、甲基和乙基,并且其中取代基 R^y 如本文所定义且尤其相互独立地选自卤素、 NO_2 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基磺酰基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基磺酰基。

[0284] 更优选 R^{Z3} 若存在的话则选自氢、卤素、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_3$ 亚烷基- CN 、 $\text{C}_1\text{-C}_3$ 亚烷基- OR^a 、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 环烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 环烷基- $\text{C}_1\text{-C}_3$ 烷基和 3-7 员饱和杂环基- $\text{C}_1\text{-C}_3$ 烷基,其中后提到的 3 个基团中的环烷基和杂环基可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^y ,其中 R^a 如本文所定义且尤其选自氢、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基,具体选自氢、甲基、乙基、二氟甲基和三氟甲基,并且其中取代基 R^y 如本文所定义且尤其相互独立地选自卤素、 NO_2 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基磺酰基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基磺酰基。

[0285] 在本发明的特别优选实施方案中, R^{Z3} 若存在的话则选自氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、环丙基、异丁基、环丙基甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2,2-三氟乙基、甲氧基甲基、二氟甲氧基甲基、三氟甲氧基甲基、氰基甲基、2-甲氧基-1-乙基、2-二氟甲氧基-1-乙基、2-三氟甲氧基-1-乙基和 2-氰基-1-乙基。

[0286] 本发明的特别优选实施方案涉及其中 A 为基团 A8-1 的式 I 化合物、其盐、其 N-氧化物和其 N-氧化物的盐以及该类化合物的方法和用途:

[0287]



[0288] 其中 #、 R^{Z2} 、 R^{Z4} 和 R^{Z5} 如本文所定义。

[0289] 优选取代基 R^{Z2} 、 R^{Z4} 和 R^{Z5} 中的一个或两个为氢。

[0290] 合适基团 A8-1 的实例是如表 A8-1 中所定义的式 A8-1. 1 至 A8-1. 173 的基团：

[0291] 表 A8_1

[0292]

(A8-1. 1)	PY4
(A8-1. 2)	2-C1-PY4
(A8-1. 3)	2-Br-PY4
(A8-1. 4)	2-CH ₃ -PY4
(A8-1. 5)	2-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 6)	2-cC ₃ H ₅ -PY4
(A8-1. 7)	2-CH(CH ₃) ₂ -PY4
(A8-1. 8)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -PY4
(A8-1. 9)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -PY4
(A8-1. 10)	2-CHF ₂ -PY4
(A8-1. 11)	2-CF ₃ -PY4
(A8-1. 12)	2-CH ₂ CF ₃ -PY4

[0293]

(A8-1. 13)	2-CH ₂ OCH ₃ -PY4
(A8-1. 14)	2-CH ₂ OCHF ₂ -PY4
(A8-1. 15)	2-CH ₂ OCF ₃ -PY4
(A8-1. 16)	2-CH ₂ CN-PY4
(A8-1. 17)	2-CH ₂ CH ₂ OCH ₃ -PY4
(A8-1. 18)	2-OCH ₃ -PY4
(A8-1. 19)	2-OCF ₃ -PY4
(A8-1. 20)	5, 6-(CH ₃) ₂ -PY4

(A8-1. 21)	5-CH ₃ -6-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 22)	6-CH ₃ -5-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 23)	5, 6-(C ₂ H ₅) ₂ -PY4
(A8-1. 24)	2, 5, 6-(CH ₃) ₃ -PY4
(A8-1. 25)	2, 5-(CH ₃) ₂ -6-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 26)	2, 6-(CH ₃) ₂ -5-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 27)	2-CH ₃ -5, 6-(C ₂ H ₅) ₂ -PY4
(A8-1. 28)	2-CF ₃ -5, 6-(CH ₃) ₂ -PY4
(A8-1. 29)	2-CF ₃ -5-CH ₃ -6-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 30)	2-CF ₃ -6-CH ₃ -5-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 31)	2-CF ₃ -5, 6-(C ₂ H ₅) ₂ -PY4
(A8-1. 32)	2-cC ₃ H ₅ -5, 6-(CH ₃) ₂ -PY4
(A8-1. 33)	2-cC ₃ H ₅ -5-CH ₃ -6-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 34)	2-cC ₃ H ₅ -6-CH ₃ -5-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 35)	2-cC ₃ H ₅ -5, 6-(C ₂ H ₅) ₂ -PY4
(A8-1. 36)	2-CH(CH ₃) ₂ -5, 6-(CH ₃) ₂ -PY4
(A8-1. 37)	2-CH(CH ₃) ₂ -5-CH ₃ -6-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 38)	2-CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₃ -5-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 39)	2-CH(CH ₃) ₂ -5, 6-(C ₂ H ₅) ₂ -PY4
(A8-1. 40)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -5, 6-(CH ₃) ₂ -PY4
(A8-1. 41)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -5-CH ₃ -6-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 42)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₃ -5-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 43)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -5, 6-(C ₂ H ₅) ₂ -PY4
(A8-1. 44)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -5, 6-(CH ₃) ₂ -PY4

(A8-1. 45)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -5-CH ₃ -6-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 46)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -6-CH ₃ -5-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 47)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -5, 6-(C ₂ H ₅) ₂ -PY4
(A8-1. 48)	6-CH ₃ -PY4
(A8-1. 49)	2-CH ₃ -6-CH ₃ -PY4
(A8-1. 50)	2-CF ₃ -6-CH ₃ -PY4
(A8-1. 51)	2-cC ₃ H ₅ -6-CH ₃ -PY4
(A8-1. 52)	2-CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₃ -PY4
(A8-1. 53)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₃ -PY4
(A8-1. 54)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -6-CH ₃ -PY4

[0294]

(A8-1. 55)	6-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 56)	2-CH ₃ -6-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 57)	2-CF ₃ -6-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 58)	2-cC ₃ H ₅ -6-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 59)	2-CH(CH ₃) ₂ -6-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 60)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -6-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 61)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -6-C ₂ H ₅ -PY4
(A8-1. 62)	6-CF ₃ -PY4
(A8-1. 63)	2-CH ₃ -6-CF ₃ -PY4
(A8-1. 64)	2, 6-(CF ₃) ₂ -PY4
(A8-1. 65)	2-cC ₃ H ₅ -6-CF ₃ -PY4
(A8-1. 66)	2-CH(CH ₃) ₂ -6-CF ₃ -PY4
(A8-1. 67)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -6-CF ₃ -PY4

(A8-1. 68)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -6-CF ₃ -PY4
(A8-1. 69)	6-CHF ₂ -PY4
(A8-1. 70)	2-CH ₃ -6-CHF ₂ -PY4
(A8-1. 71)	2-CF ₃ -6-CHF ₂ -PY4
(A8-1. 72)	2-cC ₃ H ₅ -6-CHF ₂ -PY4
(A8-1. 73)	2-CH(CH ₃) ₂ -6-CHF ₂ -PY4
(A8-1. 74)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -6-CHF ₂ -PY4
(A8-1. 75)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -6-CHF ₂ -PY4
(A8-1. 76)	6-CH ₂ CF ₃ -PY4
(A8-1. 77)	6-CH ₂ OCH ₃ -PY4
(A8-1. 78)	6-CH ₂ OCHF ₂ -PY4
(A8-1. 79)	6-CH ₂ OCF ₃ -PY4
(A8-1. 80)	6-CH ₂ CN-PY4
(A8-1. 81)	6-CH ₂ CH ₂ OCH ₃ -PY4
(A8-1. 82)	2-CH ₃ -6-CH ₂ CF ₃ -PY4
(A8-1. 83)	2-CH ₃ -6-CH ₂ OCH ₃ -PY4
(A8-1. 84)	2-CH ₃ -6-CH ₂ OCHF ₂ -PY4
(A8-1. 85)	2-CH ₃ -6-CH ₂ OCF ₃ -PY4
(A8-1. 86)	2-CH ₃ -6-CH ₂ CN-PY4
(A8-1. 87)	2-CH ₃ -6-CH ₂ CH ₂ OCH ₃ -PY4
(A8-1. 88)	2-CF ₃ -6-CH ₂ CF ₃ -PY4
(A8-1. 89)	2-CF ₃ -6-CH ₂ OCH ₃ -PY4
(A8-1. 90)	2-CF ₃ -6-CH ₂ OCHF ₂ -PY4
(A8-1. 91)	2-CF ₃ -6-CH ₂ OCF ₃ -PY4

(A8-1. 92)	2-CF ₃ -6-CH ₂ CN-PY4
(A8-1. 93)	2-CF ₃ -6-CH ₂ CH ₂ OCH ₃ -PY4
(A8-1. 94)	2-cC ₃ H ₅ -6-CH ₂ CF ₃ -PY4
(A8-1. 95)	2-cC ₃ H ₅ -6-CH ₂ OCH ₃ -PY4
(A8-1. 96)	2-cC ₃ H ₅ -6-CH ₂ OCHF ₂ -PY4

[0295]

(A8-1. 97)	2-cC ₃ H ₅ -6-CH ₂ OCF ₃ -PY4
(A8-1. 98)	2-cC ₃ H ₅ -6-CH ₂ CN-PY4
(A8-1. 99)	2-cC ₃ H ₅ -6-CH ₂ CH ₂ OCH ₃ -PY4
(A8-1. 100)	2-CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₂ CF ₃ -PY4
(A8-1. 101)	2-CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₂ OCH ₃ -PY4
(A8-1. 102)	2-CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₂ OCHF ₂ -PY4
(A8-1. 103)	2-CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₂ OCF ₃ -PY4
(A8-1. 104)	2-CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₂ CN-PY4
(A8-1. 105)	2-CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₂ CH ₂ OCH ₃ -PY4
(A8-1. 106)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₂ CF ₃ -PY4
(A8-1. 107)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₂ OCH ₃ -PY4
(A8-1. 108)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₂ OCHF ₂ -PY4
(A8-1. 109)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₂ OCF ₃ -PY4
(A8-1. 110)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₂ CN-PY4
(A8-1. 111)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₂ CH ₂ OCH ₃ -PY4
(A8-1. 112)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -6-CH ₂ CF ₃ -PY4
(A8-1. 113)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -6-CH ₂ OCH ₃ -PY4
(A8-1. 114)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -6-CH ₂ OCHF ₂ -PY4

(A8-1. 115)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -6-CH ₂ OCF ₃ -PY4
(A8-1. 116)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -6-CH ₂ CN-PY4
(A8-1. 117)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -6-CH ₂ CH ₂ OCH ₃ -PY4
(A8-1. 118)	6-Cl-PY4
(A8-1. 119)	2-CH ₃ -6-Cl-PY4
(A8-1. 120)	2-CF ₃ -6-Cl-PY4
(A8-1. 121)	2-cC ₃ H ₅ -6-Cl-PY4
(A8-1. 122)	2-CH(CH ₃) ₂ -6-Cl-PY4
(A8-1. 123)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -6-Cl-PY4
(A8-1. 124)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -6-Cl-PY4
(A8-1. 125)	6-Br-PY4
(A8-1. 126)	2-CH ₃ -6-Br-PY4
(A8-1. 127)	2-CF ₃ -6-Br-PY4
(A8-1. 128)	2-cC ₃ H ₅ -6-Br-PY4
(A8-1. 129)	2-CH(CH ₃) ₂ -6-Br-PY4
(A8-1. 130)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -6-Br-PY4v
(A8-1. 131)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -6-Br-PY4
(A8-1. 132)	6-cC ₃ H ₅ -PY4
(A8-1. 133)	6-CH(CH ₃) ₂ -PY4
(A8-1. 134)	6-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -PY4
(A8-1. 135)	6-CH ₂ cC ₃ H ₅ -PY4
(A8-1. 136)	2-CH ₃ -6-cC ₃ H ₅ -PY4
(A8-1. 137)	2-CH ₃ -6-CH(CH ₃) ₂ -PY4
(A8-1. 138)	2-CH ₃ -6-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -PY4

[0296]

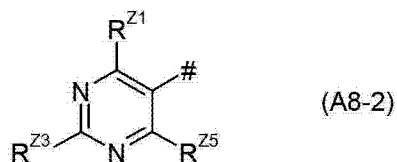
(A8-1. 139)	2-CH ₃ -6-CH ₂ cC ₃ H ₅ -PY4
(A8-1. 140)	2-CF ₃ -6-cC ₃ H ₅ -PY4
(A8-1. 141)	2-CF ₃ -6-CH(CH ₃) ₂ -PY4
(A8-1. 142)	2-CF ₃ -6-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -PY4
(A8-1. 143)	2-CF ₃ -6-CH ₂ cC ₃ H ₅ -PY4
(A8-1. 144)	2, 6-(cC ₃ H ₅) ₂ -PY4
(A8-1. 145)	2-cC ₃ H ₅ -6-CH(CH ₃) ₂ -PY4
(A8-1. 146)	2-cC ₃ H ₅ -6-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -PY4
(A8-1. 147)	2-cC ₃ H ₅ -6-CH ₂ cC ₃ H ₅ -PY4
(A8-1. 148)	2-CH(CH ₃) ₂ -6-cC ₃ H ₅ -PY4
(A8-1. 149)	2, 6-[CH(CH ₃) ₂] ₂ -PY4
(A8-1. 150)	2-CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -PY4
(A8-1. 151)	2-CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₂ cC ₃ H ₅ -PY4
(A8-1. 152)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -6-cC ₃ H ₅ -PY4
(A8-1. 153)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -6-CH(CH ₃) ₂ -PY4
(A8-1. 154)	2, 6-[CH ₂ CH(CH ₃) ₂] ₂ -PY4
(A8-1. 155)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -6-CH ₂ cC ₃ H ₅ -PY4
(A8-1. 156)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -6-cC ₃ H ₅ -PY4
(A8-1. 157)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -6-CH(CH ₃) ₂ -PY4
(A8-1. 158)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -6-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -PY4
(A8-1. 159)	2, 6-(CH ₂ cC ₃ H ₅) ₂ -PY4
(A8-1. 160)	6-OCH ₃ -PY4
(A8-1. 161)	2-CH ₃ -6-OCH ₃ -PY4

(A8-1. 162)	2-CF ₃ -6-OCH ₃ -PY4
(A8-1. 163)	2-cC ₃ H ₅ -6-OCH ₃ -PY4
(A8-1. 164)	2-CH(CH ₃) ₂ -6-OCH ₃ -PY4
(A8-1. 165)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -6-OCH ₃ -PY4
(A8-1. 166)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -6-OCH ₃ -PY4
(A8-1. 167)	6-OCHF ₂ -PY4
(A8-1. 168)	2-CH ₃ -6-OCHF ₂ -PY4
(A8-1. 169)	2-CF ₃ -6-OCHF ₂ -PY4
(A8-1. 170)	2-cC ₃ H ₅ -6-OCHF ₂ -PY4
(A8-1. 171)	2-CH(CH ₃) ₂ -6-OCHF ₂ -PY4
(A8-1. 172)	2-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -6-OCHF ₂ -PY4
(A8-1. 173)	2-CH ₂ cC ₃ H ₅ -6-OCHF ₂ -PY4

[0297] PY4= 嘧啶 -4- 基 cC₃H₅= 环丙基

[0298] 本发明的另一优选实施方案涉及其中 A 为基团 A8-2 的式 I 化合物、其盐、其 N- 氧化物和其 N- 氧化物的盐以及该类化合物的方法和用途：

[0299]



[0300] 其中 #、R^{Z1}、R^{Z3} 和 R^{Z5} 如本文所定义。

[0301] 本发明的另一优选实施方案涉及其中 A 选自基团 A8 的合适实例的式 I 化合物。

[0302] 合适基团 A8-2 的实例是如表 A8-2 中所定义的式 A8-2. 1 至 A8-2. 131 的基团。

[0303] 表 A8_2

[0304]

(A8-2.1)	5-噻定基
(A8-2.2)	2-Cl-PY5
(A8-2.3)	2-Br-PY5
(A8-2.4)	2-CH ₃ -PY5
(A8-2.5)	2-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.6)	2-c-C ₃ H ₅ -PY5
(A8-2.7)	2-CH(CH ₃) ₂ -PY5
(A8-2.8)	2-异丁基-PY5
(A8-2.9)	2-CH ₂ -c-C ₃ H ₅ -PY5
(A8-2.10)	2-CHF ₂ -PY5
(A8-2.11)	2-CF ₃ -PY5
(A8-2.12)	2-CH ₂ CF ₃ -PY5
(A8-2.13)	2-CH ₂ OCH ₃ -PY5
(A8-2.14)	2-CH ₂ OCF ₂ -PY5
(A8-2.15)	2-CH ₂ OCF ₃ -PY5
(A8-2.16)	2-CH ₂ CN-PY5
(A8-2.17)	2-CH ₂ CH ₂ OCH ₃ -PY5
(A8-2.18)	2-OCH ₃ -PY5
(A8-2.19)	2-OC ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.20)	2-Cl-4-CH ₃ -PY5
(A8-2.21)	2-Br-4-CH ₃ -PY5
(A8-2.22)	2,4-(CH ₃) ₂ -PY5
(A8-2.23)	2-C ₂ H ₅ -4-CH ₃ -PY5
(A8-2.24)	2-c-C ₃ H ₅ -4-CH ₃ -PY5
(A8-2.25)	2-CH(CH ₃) ₂ -4-CH ₃ -PY5
(A8-2.26)	2-异丁基-4-CH ₃ -PY5
(A8-2.27)	2-CH ₂ -c-C ₃ H ₅ -4-CH ₃ -PY5
(A8-2.28)	2-CHF ₂ -4-CH ₃ -PY5
(A8-2.29)	2-CF ₃ -4-CH ₃ -PY5

(A8-2.30)	2-CH ₂ CF ₃ -4-CH ₃ -PY5
(A8-2.31)	2-CH ₂ OCH ₃ -4-CH ₃ -PY5
(A8-2.32)	2-CH ₂ OCF ₂ -4-CH ₃ -PY5
(A8-2.33)	2-CH ₂ OCF ₃ -4-CH ₃ -PY5
(A8-2.34)	2-CH ₂ CN-4-CH ₃ -PY5
(A8-2.35)	2-CH ₂ OC ₂ H ₅ -4-CH ₃ -PY5
(A8-2.36)	2-OCH ₃ -4-CH ₃ -PY5
(A8-2.37)	2-OC ₂ H ₅ -4-CH ₃ -PY5
(A8-2.38)	2-Cl-4-CF ₃ -PY5
(A8-2.39)	2-Br-4-CF ₃ -PY5
(A8-2.40)	2-CH ₃ -4-CF ₃ -PY5
(A8-2.41)	2-C ₂ H ₅ -4-CF ₃ -PY5
(A8-2.42)	2-c-C ₃ H ₅ -4-CF ₃ -PY5
(A8-2.43)	2-CH(CH ₃) ₂ -4-CF ₃ -PY5
(A8-2.44)	2-异丁基-4-CF ₃ -PY5
(A8-2.45)	2-CH ₂ -c-C ₃ H ₅ -4-CF ₃ -PY5
(A8-2.46)	2-CHF ₂ -4-CF ₃ -PY5
(A8-2.47)	2-CF ₃ -4-CF ₃ -PY5
(A8-2.48)	2-CH ₂ CF ₃ -4-CF ₃ -PY5
(A8-2.49)	2-CH ₂ OCH ₃ -4-CF ₃ -PY5
(A8-2.50)	2-CH ₂ OCF ₂ -4-CF ₃ -PY5
(A8-2.51)	2-CH ₂ OCF ₃ -4-CF ₃ -PY5
(A8-2.52)	2-CH ₂ CN-4-CF ₃ -PY5
(A8-2.53)	2-CH ₂ OC ₂ H ₅ -4-CF ₃ -PY5
(A8-2.54)	2-OCH ₃ -4-CF ₃ -PY5
(A8-2.55)	2-OC ₂ H ₅ -4-CF ₃ -PY5
(A8-2.56)	2,4-Cl ₂ -PY5
(A8-2.57)	2-CH ₃ -4-Cl-PY5
(A8-2.58)	2-OC ₂ H ₅ -4-Cl-PY5
(A8-2.59)	2-c-C ₃ H ₅ -4-Cl-PY5

[0305]

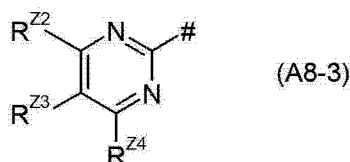
(A8-2.60)	2-CH(CH ₃) ₂ -4-Cl-PY5
(A8-2.61)	2-异丁基-4-Cl-PY5
(A8-2.62)	2-CH ₂ -c-C ₃ H ₅ -4-Cl-PY5
(A8-2.63)	2-CHF ₂ -4-Cl-PY5
(A8-2.64)	2-CF ₃ -4-Cl-PY5
(A8-2.65)	2-CH ₂ CF ₃ -4-Cl-PY5
(A8-2.66)	2-CH ₂ OCH ₃ -4-Cl-PY5
(A8-2.67)	2-CH ₂ OCHF ₂ -4-Cl-PY5
(A8-2.68)	2-CH ₂ OCF ₃ -4-Cl-PY5
(A8-2.69)	2-CH ₂ CN-4-Cl-PY5
(A8-2.70)	2-CH ₂ OC ₂ H ₅ -4-Cl-PY5
(A8-2.71)	2-OCH ₃ -4-Cl-PY5
(A8-2.72)	2-OC ₂ H ₅ -4-Cl-PY5
(A8-2.73)	2-Cl-4-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.74)	2,4-Br ₂ -PY5
(A8-2.75)	2-CH ₃ -4-Br-PY5
(A8-2.76)	2-C ₂ H ₅ -4-Br-PY5
(A8-2.77)	2-c-C ₃ H ₅ -4-Br-PY5
(A8-2.78)	2-CH(CH ₃) ₂ -4-Br-PY5
(A8-2.79)	2-异丁基-4-Br-PY5
(A8-2.80)	2-CH ₂ -c-C ₃ H ₅ -4-Br-PY5
(A8-2.81)	2-CHF ₂ -4-Br-PY5
(A8-2.82)	2-CF ₃ -4-Br-PY5
(A8-2.83)	2-CH ₂ CF ₃ -4-Br-PY5
(A8-2.84)	2-CH ₂ OCH ₃ -4-Br-PY5
(A8-2.85)	2-CH ₂ OCHF ₂ -4-Br-PY5
(A8-2.86)	2-CH ₂ OCF ₃ -4-Br-PY5
(A8-2.87)	2-CH ₂ CN-4-Br-PY5
(A8-2.88)	2-CH ₂ OC ₂ H ₅ -4-Br-PY5
(A8-2.89)	2-OCH ₃ -4-Br-PY5
(A8-2.90)	2-OC ₂ H ₅ -4-Br-PY5
(A8-2.91)	2-Br-4-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.92)	2-CH ₃ -4-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.93)	2-C ₂ H ₅ -4-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.94)	2-c-C ₃ H ₅ -4-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.95)	2-CH(CH ₃) ₂ -4-C ₂ H ₅ -PY5

(A8-2.96)	2-异丁基-4-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.97)	2-CH ₂ -c-C ₃ H ₅ -4-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.98)	2-CHF ₂ -4-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.99)	2-CF ₃ -4-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.100)	2-CH ₂ CF ₃ -4-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.101)	2-CH ₂ OCH ₃ -4-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.102)	2-CH ₂ OCHF ₂ -4-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.103)	2-CH ₂ OCF ₃ -4-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.104)	2-CH ₂ CN-4-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.105)	2-CH ₂ OC ₂ H ₅ -4-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.106)	2-OCH ₃ -4-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.107)	2-OC ₂ H ₅ -4-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.108)	2-Cl-4-CHF ₂ -PY5
(A8-2.109)	2-Br-4-CHF ₂ -PY5
(A8-2.110)	2-CH ₃ -4-CHF ₂ -PY5
(A8-2.111)	2-C ₂ H ₅ -4-CHF ₂ -PY5
(A8-2.112)	2-c-C ₃ H ₅ -4-CHF ₂ -PY5
(A8-2.113)	2-CH(CH ₃) ₂ -4-CHF ₂ -PY5
(A8-2.114)	2-异丁基-4-CHF ₂ -PY5
(A8-2.115)	2-CH ₂ -c-C ₃ H ₅ -4-CHF ₂ -PY5
(A8-2.116)	2,4-(CHF ₂) ₂ -PY5
(A8-2.117)	2-CF ₃ -4-CHF ₂ -PY5
(A8-2.118)	2-CH ₂ CF ₃ -4-CHF ₂ -PY5
(A8-2.119)	2-CH ₂ OCH ₃ -4-CHF ₂ -PY5
(A8-2.120)	2-CH ₂ OCHF ₂ -4-CHF ₂ -PY5
(A8-2.121)	2-CH ₂ OCF ₃ -4-CHF ₂ -PY5
(A8-2.122)	2-CH ₂ CN-4-CHF ₂ -PY5
(A8-2.123)	2-CH ₂ OC ₂ H ₅ -4-CHF ₂ -PY5
(A8-2.124)	2-OCH ₃ -4-CHF ₂ -PY5
(A8-2.125)	2-OC ₂ H ₅ -4-CHF ₂ -PY5
(A8-2.126)	4-CH ₃ -PY5
(A8-2.127)	4-CF ₃ -PY5
(A8-2.128)	4-Cl-PY5
(A8-2.129)	4-Br-PY5
(A8-2.130)	4-C ₂ H ₅ -PY5
(A8-2.131)	4-CHF ₂ -PY5

[0306] PY5= 嘧啶 -5- 基 c-C₃H₅= 环丙基

[0307] 本发明的另一优选实施方案涉及其中 A 为基团 A8-3 的式 I 化合物、其盐、其 N- 氧化物和其 N- 氧化物的盐以及该类化合物的方法和用途：

[0308]



[0309] 其中 #、 R^{Z2} 、 R^{Z3} 和 R^{Z4} 如本文所定义。

[0310] 合适基团 A8-3 的实例是如表 A8-3 中所定义的式 A8-3.1 至 A8-3.13 的基团。

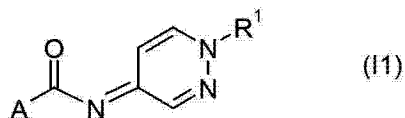
[0311] 表 A8-3

[0312]

(A8-3.1)	2-嘧啶基	(A8-3.8)	4,5-(CH ₃) ₂ -2-嘧啶基
(A8-3.2)	4-CH ₃ -2-嘧啶基	(A8-3.9)	4,5,6-(CH ₃) ₃ -2-嘧啶基
(A8-3.3)	5-CH ₃ -2-嘧啶基	(A8-3.10)	4-C ₂ H ₅ -5-CH ₃ -2-嘧啶基
(A8-3.4)	4-C ₂ H ₅ -2-嘧啶基	(A8-3.11)	4-CH ₃ -5-C ₂ H ₅ -2-嘧啶基
(A8-3.5)	5-C ₂ H ₅ -2-嘧啶基	(A8-3.12)	4-CF ₃ -5-CH ₃ -2-嘧啶基
(A8-3.6)	4-CF ₃ -2-嘧啶基	(A8-3.13)	4-CH ₃ -5-CF ₃ -2-嘧啶基
(A8-3.7)	5-CF ₃ -2-嘧啶基		

[0313] 本发明的优选实施方案涉及其中 X1 为 0 的式 I 化合物及其盐、其 N-氧化物和其 N-氧化物的盐。这些化合物在下文也称为化合物 I1。

[0314]



[0315] 在式 I1 中,变量 A 和 R^1 如本文所定义。

[0316] 在式 I1 化合物中,优选其中基团 A 和 R^1 具有优选含义之一的那些化合物。

[0317] 本发明的优选实施方案涉及如下式 I1 化合物、其 N-氧化物及其盐,其中 R^1 选自 CN、C₁-C₁₀ 烷基、C₁-C₁₀ 卤代烷基、C₃-C₁₀ 链烯基、C₃-C₁₀ 卤代链烯基、C₃-C₁₀ 炔基、C₁-C₄ 亚烷基 -CN 和 C₁-C₄ 亚烷基 -OR^a, 尤其选自 CN、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₄ 链烯基、C₃-C₄ 卤代链烯基、C₃-C₄ 炔基、C₁-C₄ 亚烷基 -CN 和 C₁-C₄ 亚烷基 -OR^a, 其中 R^a 如本文所定义且其中 R^a 在存在时优选具有作为优选含义给出的含义之一以及其中 R^a 尤其选自氢、C₁-C₄ 烷基和 C₁-C₄ 卤代烷基。

[0318] 本发明的另一优选实施方案涉及如下式 I1 化合物、其 N-氧化物及其盐,其中 R^1 选自 C₁-C₄ 亚烷基 -CN、C₁-C₄ 亚烷基 -OR^a、C₁-C₄ 亚烷基 -C(Y)R^b、C₁-C₄ 亚烷基 -NR^eR^f、C₁-C₄ 亚烷基 -C(Y)NR^gR^h、苯基 -C₁-C₄ 烷基, 尤其是苄基, 杂环基 -C₁-C₄ 烷基, 尤其是杂环基甲基, 以及杂芳基 -C₁-C₄ 烷基, 尤其是杂芳基甲基, 其中后提到的 6 个基团中的苯基、杂环基或杂芳基环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个基团 R^y, 后者如本文所定义且优选分别选自 NO₂、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基磺酰基和 C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基或选自卤素、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基。

[0319] 本发明的另一特别优选实施方案涉及如下式 I1 化合物、其 N-氧化物及其盐, 其中 R^1 选自苯基和杂芳基, 尤其选自苯基, 其中苯基和杂芳基未被取代或者带有 1、2、3、4 或 5 个基团 R^y, 后者如本文所定义且优选分别选自 NO₂、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基

磺酰基和 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基或选自卤素、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基。

[0320] 本发明的另一特别优选实施方案涉及如下式 I1 化合物、其 N-氧化物及其盐, 其中 R^1 选自 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基和 C_1-C_4 烷氧基- C_1-C_4 烷基。在该实施方案中, 特别优选其中 R^1 为 C_1-C_3 烷基的化合物。此外, 在该实施方案中, 同样优选其中 R^1 为 C_1-C_3 卤代烷基或 C_1-C_2 烷氧基- C_1-C_2 烷基的化合物。

[0321] 在另一特别优选实施方案中, 本发明涉及如下式 I1 化合物、其 N-氧化物及其盐, 其中 R^1 选自 C_1-C_4 亚烷基- NR^eR^f , 苯基- C_1-C_4 烷基, 尤其是苄基、1-苯基乙基或 2-苯基乙基, 杂环基- C_1-C_4 烷基, 尤其是杂环基甲基、1-杂环基乙基或 2-杂环基乙基, 以及杂芳基- C_1-C_4 烷基, 尤其是杂芳基甲基、1-杂芳基乙基或 2-杂芳基乙基, 其中后提到的 12 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2 或 3 个基团 R^v , 后者如上所定义且优选选自卤素、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷基磺酰基和 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基。

[0322] 本发明的非常优选实施方案涉及如下式 I1 化合物及其盐、其 N-氧化物和其 N-氧化物的盐, 其中 A 为基团 A2, 尤其是如下基团 A2, 其中 Z 为 $N-R^N$, 其中 R^N 如本文所定义且其中 R^N 优选选自 NO_2 、 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 链烯基和 C_2-C_{10} 炔基, 其中后提到的 3 个基团可以未被取代、可以被部分或完全卤代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^x , 或者其中 R^N 进一步选自 OR^a 、 $C(Y)R^b$ 、 $C(Y)OR^c$ 、 $S(O)_mR^d$ 、 NR^eR^f 、 $C(Y)NR^gR^h$ 、 $S(O)_mNR^eR^f$ 、 $C(Y)NR^iNR^eR^f$ 、 C_1-C_5 亚烷基- OR^a 、 C_1-C_5 亚烷基-CN、 C_1-C_5 亚烷基- $C(Y)R^b$ 、 C_1-C_5 亚烷基- $C(Y)OR^c$ 、 C_1-C_5 亚烷基- NR^eR^f 、 C_1-C_5 亚烷基- $C(Y)NR^gR^h$ 、 C_1-C_5 亚烷基- $S(O)_mR^d$ 、 C_1-C_5 亚烷基- $S(O)_mNR^eR^f$ 、 C_1-C_5 亚烷基- $NR^iNR^eR^f$ 、杂环基、杂芳基、 C_3-C_{10} 环烷基、 C_5-C_{10} 环烯基、杂环基- C_1-C_5 烷基、杂芳基- C_1-C_5 烷基、 C_3-C_{10} 环烷基- C_1-C_5 烷基、 C_5-C_{10} 环烯基- C_1-C_5 烷基、苯基- C_1-C_5 烷基和苯基, 其中后提到的 10 个基团的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^v 。

[0323] 在其中 A 为 A2 且 Z 为 $N-R^N$ 的式 I1 化合物中, R^N 更优选选自 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 链烯基和 C_2-C_{10} 炔基, 其中后提到的 3 个基团可以未被取代、可以被部分或完全卤代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^x , C_1-C_4 烷氧基- C_2-C_4 烷基、 C_1-C_4 亚烷基-CN、杂环基、杂芳基、 C_3-C_{10} 环烷基、 C_5-C_{10} 环烯基、杂环基- C_1-C_5 烷基、杂芳基- C_1-C_5 烷基、 C_3-C_{10} 环烷基- C_1-C_5 烷基、 C_5-C_{10} 环烯基- C_1-C_5 烷基, 其中后提到的 8 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^v 。

[0324] 在其中 A 为 A2 且 Z 为 $N-R^N$ 的式 I1 化合物中, R^N 更优选选自 C_1-C_6 烷基, C_1-C_6 卤代烷基, C_3-C_6 环烷基, C_3-C_6 环烷基- C_1-C_4 烷基, 其中后提到的 2 个基团中的环烷基结构部分未被取代或者带有 1 或 2 个选自卤素、CN 和 C_1-C_2 卤代烷基的基团, 杂环基- C_1-C_4 烷基, C_1-C_4 烷氧基- C_1-C_4 烷基和 C_1-C_4 亚烷基-CN。 R^N 尤其选自 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_2 烷氧基- C_2-C_4 烷基、 C_1-C_4 亚烷基-CN、 C_3-C_6 环烷基和 C_3-C_6 环烷基- C_1-C_4 烷基, 其中后提到的 2 个基团中的环烷基结构部分未被取代或者带有 1 或 2 个选自卤素、CN 和 C_1-C_2 卤代烷基的基团。 R^N 尤其为 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 卤代烷基。

[0325] 在其中式 I1 中的 A 为基团 A2 (其中 Z 为 $N-R^N$) 的本发明的该非常优选实施方案中, 基团 A 例如选自式 A2. a、A2. b、A2. c、A2. d、A2. e、A2. f、A2. g、A2. h、A2. i、A2. k、A2. l、A2. m、A2. n、A2. o、A2. p、A2. q、A2. r、A2. s、A2. t、A2. u、A2. v、A2. w、A2. x、A2. y、A2. z、A2. aa、

A2. bb、A2. cc、A2. dd、A2. ee、A2. ff、A2. gg、A2. hh、A2. ii、A2. kk、A2. mm、A2. nn、A2. oo、A2. pp、A2. qq、A2. rr、A2. ss 和 A2. tt 的基团, 优选基团 A2. a、A2. b、A2. c、A2. d、A2. e、A2. f、A2. n、A2. o、A2. q、A2. r、A2. s、A2. t、A2. u、A2. v、A2. w、A2. x、A2. y、A2. z、A2. aa、A2. bb、A2. cc、A2. dd、A2. ee、A2. gg、A2. hh、A2. ii、A2. rr、A2. ss 和 A2. tt, 特别优选式 A2. o、A2. p、A2. r 和 A2. tt 的基团, 其中 Z 为 NR^{N} , 其中 R^{N} 如表 R^{N} 的各行所定义, 尤其如第 R. N 1-R. N 8、R. N 13、R. N 15、R. N23、R. N24、R. N 73-R. N 78 和 R. N 82-R. N 95 行所定义。

[0326] 在该上述实施方案中, 进一步非常特别优选如下的式 I1 化合物, 其中 A 为基团 A2, 其中 Z 为 N-R^{N} , 例如选自基团 A2. N1-A2. N13、A2. N40-A2. N52、A2. N79-A2. N91、A2. N119-A2. N130、A2. N157-A2. N169、A2. N196-A2. N208、A2. N235-A2. N247、A2. N274-A2. N286、A2. N313-A2. N325、A2. N352-A2. N364、A2. N391-A2. N403、A2. N430-A2. N442、A2. N469-A2. N481、A2. N508-A2. N520、A2. N547-A2. N559、A2. N586-A2. N598、A2. N625-A2. N637、A2. N664-A2. N676、A2. N703-A2. N715、A2. N742-A2. N754、A2. N781-A2. N793、A2. N820-A2. N832、A2. N859-A2. N871、A2. N898-A2. N910、A2. N937-A2. N949 和 A2. N976-A2. N988 的基团。

[0327] 该特别优选实施方案的化合物实例是下表 1-338 中所给化合物。这些化合物的对应盐、其 N-氧化物及其 N-氧化物的盐也包括在该实施方案中。此外, 对表中取代基所提到的基团本身为所述取代基的特别优选方面, 与其中提到它们的组合无关。

[0328] 表 1: 其中 A 为基团 A2-N1 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0329] 表 2: 其中 A 为基团 A2-N2 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0330] 表 3: 其中 A 为基团 A2-N3 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0331] 表 4: 其中 A 为基团 A2-N4 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0332] 表 5: 其中 A 为基团 A2-N5 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0333] 表 6: 其中 A 为基团 A2-N6 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0334] 表 7: 其中 A 为基团 A2-N7 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0335] 表 8: 其中 A 为基团 A2-N8 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0336] 表 9: 其中 A 为基团 A2-N9 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0337] 表 10: 其中 A 为基团 A2-N10 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0338] 表 11: 其中 A 为基团 A2-N11 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0339] 表 12: 其中 A 为基团 A2-N12 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0340] 表 13: 其中 A 为基团 A2-N13 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0341] 表 14: 其中 A 为基团 A2-N40 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0342] 表 15: 其中 A 为基团 A2-N41 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0343] 表 16: 其中 A 为基团 A2-N42 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0344] 表 17: 其中 A 为基团 A2-N43 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0345] 表 18: 其中 A 为基团 A2-N44 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0346] 表 19: 其中 A 为基团 A2-N45 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0347] 表 20: 其中 A 为基团 A2-N46 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0348] 表 21: 其中 A 为基团 A2-N47 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0349] 表 22: 其中 A 为基团 A2-N48 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0350] 表 23: 其中 A 为基团 A2-N49 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

- [0351] 表 24 :其中 A 为基团 A2-N50 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0352] 表 25 :其中 A 为基团 A2-N51 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0353] 表 26 :其中 A 为基团 A2-N52 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0354] 表 27 :其中 A 为基团 A2-N79 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0355] 表 28 :其中 A 为基团 A2-N80 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0356] 表 29 :其中 A 为基团 A2-N81 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0357] 表 30 :其中 A 为基团 A2-N82 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0358] 表 31 :其中 A 为基团 A2-N83 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0359] 表 32 :其中 A 为基团 A2-N84 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0360] 表 33 :其中 A 为基团 A2-N85 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0361] 表 34 :其中 A 为基团 A2-N86 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0362] 表 35 :其中 A 为基团 A2-N87 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0363] 表 36 :其中 A 为基团 A2-N88 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0364] 表 37 :其中 A 为基团 A2-N89 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0365] 表 38 :其中 A 为基团 A2-N90 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0366] 表 39 :其中 A 为基团 A2-N91 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0367] 表 40 :其中 A 为基团 A2-N118 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0368] 表 41 :其中 A 为基团 A2-N119 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0369] 表 42 :其中 A 为基团 A2-N120 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0370] 表 43 :其中 A 为基团 A2-N121 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0371] 表 44 :其中 A 为基团 A2-N122 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0372] 表 45 :其中 A 为基团 A2-N123 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0373] 表 46 :其中 A 为基团 A2-N124 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0374] 表 47 :其中 A 为基团 A2-N125 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0375] 表 48 :其中 A 为基团 A2-N126 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0376] 表 49 :其中 A 为基团 A2-N127 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0377] 表 50 :其中 A 为基团 A2-N128 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0378] 表 51 :其中 A 为基团 A2-N129 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0379] 表 52 :其中 A 为基团 A2-N130 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0380] 表 53 :其中 A 为基团 A2-N157 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0381] 表 54 :其中 A 为基团 A2-N158 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0382] 表 55 :其中 A 为基团 A2-N159 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0383] 表 56 :其中 A 为基团 A2-N160 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0384] 表 57 :其中 A 为基团 A2-N161 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0385] 表 58 :其中 A 为基团 A2-N162 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0386] 表 59 :其中 A 为基团 A2-N163 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0387] 表 60 :其中 A 为基团 A2-N164 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0388] 表 61 :其中 A 为基团 A2-N165 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0389] 表 62 :其中 A 为基团 A2-N166 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

- [0390] 表 63 :其中 A 为基团 A2-N167 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0391] 表 64 :其中 A 为基团 A2-N168 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0392] 表 65 :其中 A 为基团 A2-N169 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0393] 表 66 :其中 A 为基团 A2-N196 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0394] 表 67 :其中 A 为基团 A2-N197 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0395] 表 68 :其中 A 为基团 A2-N198 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0396] 表 69 :其中 A 为基团 A2-N199 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0397] 表 70 :其中 A 为基团 A2-N200 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0398] 表 71 :其中 A 为基团 A2-N201 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0399] 表 72 :其中 A 为基团 A2-N202 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0400] 表 73 :其中 A 为基团 A2-N203 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0401] 表 74 :其中 A 为基团 A2-N204 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0402] 表 75 :其中 A 为基团 A2-N205 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0403] 表 76 :其中 A 为基团 A2-N206 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0404] 表 77 :其中 A 为基团 A2-N207 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0405] 表 78 :其中 A 为基团 A2-N208 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0406] 表 79 :其中 A 为基团 A2-N235 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0407] 表 80 :其中 A 为基团 A2-N236 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0408] 表 81 :其中 A 为基团 A2-N237 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0409] 表 82 :其中 A 为基团 A2-N238 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0410] 表 83 :其中 A 为基团 A2-N239 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0411] 表 84 :其中 A 为基团 A2-N240 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0412] 表 85 :其中 A 为基团 A2-N241 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0413] 表 86 :其中 A 为基团 A2-N242 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0414] 表 87 :其中 A 为基团 A2-N243 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0415] 表 88 :其中 A 为基团 A2-N244 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0416] 表 89 :其中 A 为基团 A2-N245 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0417] 表 90 :其中 A 为基团 A2-N246 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0418] 表 91 :其中 A 为基团 A2-N247 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0419] 表 92 :其中 A 为基团 A2-N274 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0420] 表 93 :其中 A 为基团 A2-N275 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0421] 表 94 :其中 A 为基团 A2-N276 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0422] 表 95 :其中 A 为基团 A2-N277 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0423] 表 96 :其中 A 为基团 A2-N278 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0424] 表 97 :其中 A 为基团 A2-N279 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0425] 表 98 :其中 A 为基团 A2-N280 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0426] 表 99 :其中 A 为基团 A2-N281 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0427] 表 100 :其中 A 为基团 A2-N282 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0428] 表 101 :其中 A 为基团 A2-N283 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

- [illegible]

- [illegible]

- [illegible]

- [0585] 表 258 :其中 A 为基团 A2-N752 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0586] 表 259 :其中 A 为基团 A2-N753 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0587] 表 260 :其中 A 为基团 A2-N754 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0588] 表 261 :其中 A 为基团 A2-N781 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0589] 表 262 :其中 A 为基团 A2-N782 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0590] 表 263 :其中 A 为基团 A2-N783 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0591] 表 264 :其中 A 为基团 A2-N784 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0592] 表 265 :其中 A 为基团 A2-N785 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0593] 表 266 :其中 A 为基团 A2-N786 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0594] 表 267 :其中 A 为基团 A2-N787 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0595] 表 268 :其中 A 为基团 A2-N788 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0596] 表 269 :其中 A 为基团 A2-N789 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0597] 表 270 :其中 A 为基团 A2-N790 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0598] 表 271 :其中 A 为基团 A2-N791 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0599] 表 272 :其中 A 为基团 A2-N792 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0600] 表 273 :其中 A 为基团 A2-N793 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0601] 表 274 :其中 A 为基团 A2-N820 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0602] 表 275 :其中 A 为基团 A2-N821 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0603] 表 276 :其中 A 为基团 A2-N822 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0604] 表 277 :其中 A 为基团 A2-N823 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0605] 表 278 :其中 A 为基团 A2-N824 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0606] 表 279 :其中 A 为基团 A2-N825 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0607] 表 280 :其中 A 为基团 A2-N826 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0608] 表 281 :其中 A 为基团 A2-N827 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0609] 表 282 :其中 A 为基团 A2-N828 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0610] 表 283 :其中 A 为基团 A2-N829 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0611] 表 284 :其中 A 为基团 A2-N830 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0612] 表 285 :其中 A 为基团 A2-N831 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0613] 表 286 :其中 A 为基团 A2-N832 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0614] 表 287 :其中 A 为基团 A2-N859 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0615] 表 288 :其中 A 为基团 A2-N860 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0616] 表 289 :其中 A 为基团 A2-N861 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0617] 表 290 :其中 A 为基团 A2-N862 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0618] 表 291 :其中 A 为基团 A2-N863 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0619] 表 292 :其中 A 为基团 A2-N864 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0620] 表 293 :其中 A 为基团 A2-N865 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0621] 表 294 :其中 A 为基团 A2-N866 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0622] 表 295 :其中 A 为基团 A2-N867 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0623] 表 296 :其中 A 为基团 A2-N868 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

- [illegible]

[0663] 表 336 :其中 A 为基团 A2-N986 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0664] 表 337 :其中 A 为基团 A2-N987 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0665] 表 338 :其中 A 为基团 A2-N988 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0666] 表 B :

[0667]

序号	基团 R ¹
1	CH ₃
2	CH ₂ CH ₃
3	CH ₂ CH ₂ CH ₃
4	CH ₂ (CH ₃) ₂
5	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
6	C(CH ₃) ₃
7	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
8	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
9	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
10	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
11	CH(OCH ₃)CH ₃
12	CH(OCH ₂ CH ₃)CH ₃
13	环丙基甲基
14	CH ₂ CN
15	CH(CN)CH ₃
16	CH ₂ CH ₂ (CN)
17	CH ₂ CH=CH ₂
18	环丙基
19	CH ₂ CF ₃

序号	基团 R ¹
20	吡啶-2-基甲基
21	吡啶-3-基甲基
22	吡啶-4-基甲基
23	呋喃-2-基甲基
24	呋喃-3-基甲基
25	噻吩-2-基甲基
26	噻吩-3-基甲基
27	四氢呋喃-2-基甲基
28	四氢呋喃-3-基甲基
29	吡咯-2-基甲基
30	吡咯-3-基甲基
31	1-甲基吡咯-3-基甲基
32	1-甲基吡咯-2-基甲基
33	CH ₂ C ₆ H ₅
34	顺式-2-丁烯-1-基
35	反式-2-丁烯-1-基
36	CH ₂ C≡CH
37	CH ₂ C≡CCH ₃

[0668] 本发明的非常优选实施方案涉及如下的式 I1 化合物及其盐、其 N-氧化物和其 N-氧化物的盐,其中 A 为基团 A8。

[0669] 在该实施方案中,进一步非常特别优选如下式 I1 化合物,其中 A 为选自基团 A8-1、A8-2 和 A8-3,特别是选自基团 A8-1.1 至 A8-1.173、A8-2.1 至 A8-2.131 和 A8-3.1 至 A8-3.13 的基团 A8。

[0670] 该特别优选实施方案的化合物实例是下表 339-655 中所给化合物。此外,对表中取代基所提到的基团本身为所述取代基的特别优选方面,与其中提到它们的组合无关。

[0671] 表 339 :其中 A 为基团 A8-1.1 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0672] 表 340 :其中 A 为基团 A8-1.2 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0673] 表 341 :其中 A 为基团 A8-1.3 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0674] 表 342 :其中 A 为基团 A8-1.4 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0675] 表 343 :其中 A 为基团 A8-1.5 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0676] 表 344 :其中 A 为基团 A8-1.6 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

[0677] 表 345 :其中 A 为基团 A8-1.7 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

- [illegible]

- [illegible]

- [illegible]

- [0834] 表 502 :其中 A 为基团 A8-1. 164 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0835] 表 503 :其中 A 为基团 A8-1. 165 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0836] 表 504 :其中 A 为基团 A8-1. 166 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0837] 表 505 :其中 A 为基团 A8-1. 167 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0838] 表 506 :其中 A 为基团 A8-1. 168 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0839] 表 507 :其中 A 为基团 A8-1. 169 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0840] 表 508 :其中 A 为基团 A8-1. 170 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0841] 表 509 :其中 A 为基团 A8-1. 171 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0842] 表 510 :其中 A 为基团 A8-1. 172 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0843] 表 511 :其中 A 为基团 A8-1. 173 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0844] 表 512 :其中 A 为基团 A8-2. 1 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0845] 表 513 :其中 A 为基团 A8-2. 2 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0846] 表 514 :其中 A 为基团 A8-2. 3 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0847] 表 515 :其中 A 为基团 A8-2. 4 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0848] 表 516 :其中 A 为基团 A8-2. 5 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0849] 表 517 :其中 A 为基团 A8-2. 6 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0850] 表 518 :其中 A 为基团 A8-2. 7 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0851] 表 519 :其中 A 为基团 A8-2. 8 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0852] 表 520 :其中 A 为基团 A8-2. 9 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0853] 表 521 :其中 A 为基团 A8-2. 10 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0854] 表 522 :其中 A 为基团 A8-2. 11 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0855] 表 523 :其中 A 为基团 A8-2. 12 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0856] 表 524 :其中 A 为基团 A8-2. 13 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0857] 表 525 :其中 A 为基团 A8-2. 14 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0858] 表 526 :其中 A 为基团 A8-2. 15 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0859] 表 527 :其中 A 为基团 A8-2. 16 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0860] 表 528 :其中 A 为基团 A8-2. 17 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0861] 表 529 :其中 A 为基团 A8-2. 18 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0862] 表 530 :其中 A 为基团 A8-2. 19 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0863] 表 531 :其中 A 为基团 A8-2. 20 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0864] 表 532 :其中 A 为基团 A8-2. 21 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0865] 表 533 :其中 A 为基团 A8-2. 22 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0866] 表 534 :其中 A 为基团 A8-2. 23 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0867] 表 535 :其中 A 为基团 A8-2. 24 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0868] 表 536 :其中 A 为基团 A8-2. 25 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0869] 表 537 :其中 A 为基团 A8-2. 26 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0870] 表 538 :其中 A 为基团 A8-2. 27 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0871] 表 539 :其中 A 为基团 A8-2. 28 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0872] 表 540 :其中 A 为基团 A8-2. 29 且 R^1 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。

- 75

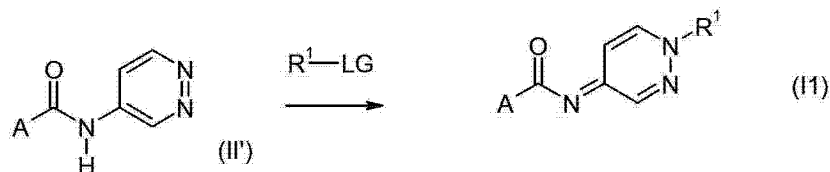
- [illegible]

- [0951] 表 619 :其中 A 为基团 A8-2. 108 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0952] 表 620 :其中 A 为基团 A8-2. 109 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0953] 表 621 :其中 A 为基团 A8-2. 110 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0954] 表 622 :其中 A 为基团 A8-2. 111 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0955] 表 623 :其中 A 为基团 A8-2. 112 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0956] 表 624 :其中 A 为基团 A8-2. 113 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0957] 表 625 :其中 A 为基团 A8-2. 114 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0958] 表 626 :其中 A 为基团 A8-2. 115 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0959] 表 627 :其中 A 为基团 A8-2. 116 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0960] 表 628 :其中 A 为基团 A8-2. 17 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0961] 表 629 :其中 A 为基团 A8-2. 118 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0962] 表 630 :其中 A 为基团 A8-2. 119 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0963] 表 631 :其中 A 为基团 A8-2. 120 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0964] 表 632 :其中 A 为基团 A8-2. 121 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0965] 表 633 :其中 A 为基团 A8-2. 122 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0966] 表 634 :其中 A 为基团 A8-2. 123 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0967] 表 635 :其中 A 为基团 A8-2. 124 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0968] 表 636 :其中 A 为基团 A8-2. 125 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0969] 表 637 :其中 A 为基团 A8-2. 126 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0970] 表 638 :其中 A 为基团 A8-2. 127 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0971] 表 639 :其中 A 为基团 A8-2. 128 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0972] 表 640 :其中 A 为基团 A8-2. 129 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0973] 表 641 :其中 A 为基团 A8-2. 130 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0974] 表 642 :其中 A 为基团 A8-2. 131 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0975] 表 643 :其中 A 为基团 A8-3. 1 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0976] 表 644 :其中 A 为基团 A8-3. 2 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0977] 表 645 :其中 A 为基团 A8-3. 3 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0978] 表 646 :其中 A 为基团 A8-3. 4 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0979] 表 647 :其中 A 为基团 A8-3. 5 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0980] 表 648 :其中 A 为基团 A8-3. 6 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0981] 表 649 :其中 A 为基团 A8-3. 7 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0982] 表 650 :其中 A 为基团 A8-3. 8 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0983] 表 651 :其中 A 为基团 A8-3. 9 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0984] 表 652 :其中 A 为基团 A8-3. 10 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0985] 表 653 :其中 A 为基团 A8-3. 11 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0986] 表 654 :其中 A 为基团 A8-3. 12 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0987] 表 655 :其中 A 为基团 A8-3. 13 且 R¹ 具有表 B 中所给含义之一的式 I1 化合物。
- [0988] 这些优选实施方案的其他实例由本文中上面所定义的本发明优选化合物的盐和 N- 氧化物表示。

[0989] 其中 X 为 0 的式 I 化合物 (化合物 I1) 例如可以根据方案 1 中所示方法通过使 N-(4-吡嗪基) 甲酰胺 II' 与活化的化合物 R¹-LG (LG= 离去基团) 在 N- 烷基化反应的意义上反应而制备。该反应可以类似于吡嗪类的已知 N- 烷基化进行。吡嗪类的 N- 烷基化在文献中已知且例如可以在 N. Haider, G. Heinisch, J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1 1988, 401 和 S.-F. Chen, R. P. Panzica, J. Org. Chem. 1981, 46, 2467 中找到。

[0990] 方案 1:

[0991]



[0992] 在方案 1 中, 基团 A 和 R¹ 具有上面所给含义, 尤其是作为优选给出的含义。LG 为常规离去基团。常规离去基团包括卤素, 如 Cl、Br、I, (卤代) 烷基磺酸酯和芳基磺酸酯基团 (R-SO₂O, 其中 R 为未被取代或者带有 1、2 或 3 个惰性基团如甲基、氯或甲氧基的芳基如苯基, 或者 R 为烷基或卤代烷基), 如甲磺酸酯、苯基磺酸酯、三氟甲磺酸酯 (OTf) 或甲苯磺酸酯基团, 或者 LG 还可以为烷基硫酸酯如甲基硫酸酯 (CH₃OSO₂O) 或 (卤代) 烷基羧酸酯如乙酸酯或三氟乙酸酯。

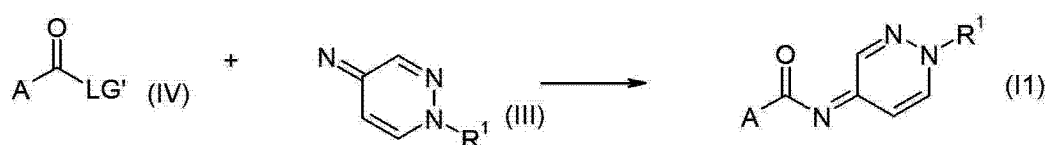
[0993] 方案 1 的反应特别适合其中 LG 经由脂族碳原子连接于 R¹, 即 LG 所连接的 R¹ 的碳原子为脂族碳原子, 尤其是伯碳原子 (CH₂) 或仲碳原子 (CH) 的化合物。方案 1 的反应通常在碱存在下进行。合适的碱例如包括碱金属氢化物, 如 NaH、LiH、KH 等, 碱金属氢氧化物, 如 NaOH、KOH 等, 或碱金属碳酸盐, 如 Na₂CO₃、K₂CO₃ 或 Cs₂CO₃。该反应优选在溶剂中, 更优选在非质子溶剂如二甲基甲酰胺 (DMF)、乙腈、二甲亚砜 (DMSO)、二氯甲烷 (DCM)、酮类如环己酮、丙酮或甲基乙基酮或其混合物中进行。

[0994] 碱的量优选相对于化合物 R¹-LG 至少几乎呈化学计量, 即碱的量优选相对于化合物 R¹-LG 至少为 0.95 当量, 尤其是相对于化合物 R¹-LG 为 0.95-5 当量。化合物 R¹-LG 相对于式 II' 化合物可以以几乎化学计算量或过量使用, 例如 0.9-5mol/mol 化合物 II'。反应温度可以在 0℃ 至反应混合物的回流温度内变化, 例如 0-200℃ 或 5-150℃。

[0995] 其中 X 为 0 的式 I 化合物 (化合物 I1) 也可以根据方案 2 所示方法通过使式 III 的 1- 取代的 4- 吡嗪亚胺与式 IV 的酰化剂反应而制备:

[0996] 方案 2:

[0997]



[0998] 在方案 2 中, 基团 A 和 R¹ 具有上面所给含义, 尤其是作为优选给出的含义。LG' 为合适的离去基团, 如 OH、卤素、N₃、对硝基苯氧基或五氟苯氧基等。方案 2 的反应特别适合其中 R¹ 为芳基 (即任选取代的苯基) 或杂芳基的化合物。合适的酰化剂 IV 是羧酸 (即 LG' 为 OH) 以及活化的羧酸衍生物, 其中 LG' 例如为卤素、N₃、对硝基苯氧基或五氟苯氧基等。

[0999] 活化的羧酸衍生物可以类似于例如公开于 Houben-Weyl: "Methoden der organ.

Chemie”[有机化学方法], Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart, New York 1985, 第 E5 卷, 第 941-1045 页) 或 EP 78989 或 DE 3436550 中的标准程序反应。其中 LG' 为 OH 的化合物 IV 优选在偶联剂存在下与化合物 III 反应。合适的偶联剂和反应条件例如可以选自:

[1000] - 基于碳二亚胺的偶联剂, 例如 N,N' - 二环己基碳二亚胺 [J. C. Sheehan, G. P. Hess, J. Am. Chem. Soc. 1955, 77, 1067], N-(3-二甲氨基丙基)-N' - 乙基碳二亚胺;

[1001] - 与碳酸酯形成混合酸酐的偶联剂, 例如 2-乙氧基-1-乙氧羰基-1,2-二氢喹啉 [B. Belleau, G. Malek, J. Amer. Chem. Soc. 1968, 90, 1651]、2-异丁氧基-1-异丁氧羰基-1,2-二氢喹啉 [Y. Kiso, H. Yajima, J. Chem. Soc., Chem. Commun. 1972, 942];

[1002] - 基于磷盐的偶联剂, 例如 (苯并三唑-1-基氧基) 三(二甲氨基)磷六氟磷酸盐 [B. Castro, J. R. Domoy, G. Evin, C. Selve, Tetrahedron Lett. 1975, 14, 1219]、(苯并三唑-1-基氧基) 三吡咯烷基磷六氟磷酸盐 [J. Coste 等, Tetrahedron Lett. 1990, 31, 205];

[1003] - 基于脲鎓 (uranium) 盐或具有胍鎓 N-氧化物结构的偶联剂, 例如 N,N,N',N' - 四甲基-O-(1H-苯并三唑-1-基)脲鎓六氟磷酸盐 [R. Knorr, A. Trzeciak, W. Bannwarth, D. Gillesen, Tetrahedron Lett. 1989, 30, 1927], N,N,N',N' - 四甲基-O-(苯并三唑-1-基)脲鎓四氟硼酸盐, (苯并三唑-1-基氧基)二哌啶子基碳鎓六氟磷酸盐 [S. Chen, J. Xu, Tetrahedron Lett. 1992, 33, 647];

[1004] - 形成酰氯的偶联剂, 例如二(2-氧代噁唑烷基)膦酰氯 [J. Diago-Mesequer, Synthesis 1980, 547]。

[1005] 式 III 化合物例如由 EP 78989、EP 227941 和 DE 3436550 已知或者可以类似于其中所述方法制备。

[1006] X=S 的化合物可以根据本领域中所述方法, 例如通过使式 I1 化合物与 2,4-二(4-甲氧基苯基)-1,3,2,4-二硫杂二磷杂己环 (dithiadiphosphetane)-2,4-二硫化物或五硫化二磷根据 M. Jesberger 等在 Synthesis 2003, 1929 中所述方法反应而由上述式 I1 化合物 (X=O) 制备。

[1007] 式 I 或 I1 化合物的 N-氧化物可以通过根据制备杂芳族 N-氧化物的标准方法, 例如通过 C. Botteghi 等在 Journal of Organometallic Chemistry 1989, 370, 17-31 中所述方法氧化化合物 I 或 I1 而制备。

[1008] 式 I 或 I1 化合物通常可以通过上述方法制备。若各化合物不能经由上述途径制备, 则它们可以通过衍生其他化合物 I 或 I1 或通过所述合成途径的常规改变而制备。例如, 在各种情况下, 某些化合物 I 或 II 可以有利地通过酯水解、酰胺化、酯化、醚裂解、烯炔化、还原、氧化等由其他化合物 I 或 I1 制备。

[1009] 反应混合物以常规方式后处理, 例如通过与水混合、分离各相并且合适的话通过层析, 例如在矾土或硅胶上层析而提纯粗产物。一些中间体和终产物可以以无色或浅棕色粘稠油形式得到, 将它们在减压和温和升高的温度下除去挥发性组分或提纯。若中间体和终产物以固体得到, 则它们可以通过重结晶或研制进行提纯。

[1010] 由于其优异的活性, 通式 I 的化合物可以用于防治无脊椎动物害虫。

[1011] 因此, 本发明还提供了一种防治无脊椎动物害虫的方法, 该方法包括用杀虫有效

量的如上所定义的式 (I) 化合物或其盐或 N- 氧化物或组合物处理害虫、其食物供应源、其栖息地或其繁殖地或其中害虫生长或可能生长的栽培植物、植物繁殖材料 (如种子)、土壤、区域、材料或环境或者要防止害虫侵袭或侵染的材料、栽培植物、植物繁殖材料 (如种子)、土壤、表面或空间。

[1012] 优选本发明方法用于保护植物繁殖材料 (如种子) 和由其生长的植物以防无脊椎动物害虫侵袭或侵染且包括用杀虫有效量的如上所定义的式 (I) 化合物或其可农用盐或 N- 氧化物或用杀虫有效量的如上文和下文所定义的农业组合物处理植物繁殖材料 (如种子)。本发明方法不限于保护已经根据本发明处理的“底物” (植物、植物繁殖材料、土壤材料等), 而是还具有预防效果, 因此例如可以相应地保护由已处理的植物繁殖材料 (如种子) 生长的植物, 但植物本身并未被处理。

[1013] 就本发明而言, “无脊椎动物害虫” 优选选自节肢动物害虫和线虫, 更优选选自有害昆虫、蜘蛛和线虫, 甚至更优选选自昆虫、螨虫和线虫。就本发明而言, “无脊椎动物害虫” 最优选为昆虫, 优选同翅目昆虫。

[1014] 本发明进一步提供了一种防除该类无脊椎动物害虫的农业组合物, 其包含具有杀虫作用量的至少一种通式 I 的化合物或至少一种其可农用盐或其 N- 氧化物和至少一种惰性液体和 / 或固体可农用载体以及需要的话至少一种表面活性剂。

[1015] 该组合物可以含有式 I 的单一活性化合物或其盐或 N- 氧化物或几种本发明活性化合物 I 或 II 或其盐的混合物。本发明组合物可以包含单独的异构体或异构体混合物以及单独的互变异构体或互变异构体混合物。

[1016] 式 I 化合物和包含它们的杀虫组合物是防治节肢动物害虫和线虫的有效试剂。由式 I 化合物防治的无脊椎动物害虫例如包括:

[1017] 鳞翅目昆虫 (鳞翅目 (Lepidoptera)), 例如小地老虎 (*Agrotis ypsilon*)、黄地老虎 (*Agrotis segetum*)、木棉虫 (*Alabama argillacea*)、黎豆夜蛾 (*Anticarsia gemmatalis*)、*Argyresthia conjugella*、叉纹夜蛾 (*Autographa gamma*)、树尺蠖 (*Bupalus piniarius*)、*Cacoecia murinana*、*Capua reticulana*、*Cheimatobia brumata*、云杉色卷蛾 (*Choristoneura fumiferana*)、*Choristoneura occidentalis*、二化螟 (*Cirphis unipuncta*)、苹果小卷蛾 (*Cydia pomonella*)、松毛虫 (*Dendrolimus pini*)、*Diaphania nitidalis*、西南玉米秆草螟 (*Diatraea grandiosella*)、埃及钻夜蛾 (*Earias insulana*)、南美玉米苗斑螟 (*Elasmopalpus lignosellus*)、女贞细卷蛾 (*Eupoecilia ambiguella*)、*Evetria bouliana*、*Feltia subterranea*、蜡螟 (*Galleria mellonella*)、李小食心虫 (*Grapholitha funebrana*)、梨小食心虫 (*Grapholitha molesta*)、棉铃虫 (*Heliothis armigera*)、烟芽夜蛾 (*Heliothis virescens*)、玉米穗虫 (*Heliothis zea*)、菜螟 (*Hellula undalis*)、*Hibernia defoliaria*、美国白蛾 (*Hyphantria cunea*)、苹果巢蛾 (*Hyponomeuta malinellus*)、番茄虫蛾 (*Keiferia lycopersicella*)、*Lambdina fiscellaria*、甜菜夜蛾 (*Laphygma exigua*)、咖啡潜叶蛾 (*Leucoptera coffeella*)、旋纹潜蛾 (*Leucoptera scitella*)、*Lithocolletis blancardella*、葡萄浆果小卷蛾 (*Lobesia botrana*)、甜菜网螟 (*Loxostege sticticalis*)、舞毒蛾 (*Lymantria dispar*)、模毒蛾 (*Lymantria monacha*)、桃潜蛾 (*Lyonetia clerkella*)、黄褐天幕毛虫 (*Malacosoma neustria*)、甘蓝夜蛾 (*Mamestra brassicae*)、黄杉毒蛾 (*Orgyia pseudotsugata*)、玉米螟 (*Ostrinia*

nubilalis)、小眼夜蛾 (*Panolis flammea*)、棉花红铃虫 (*Pectinophora gossypiella*)、疆夜蛾 (*Peridroma saucia*)、圆掌舟蛾 (*Phalera bucephala*)、马铃薯麦蛾 (*Phthorimaea operculella*)、柑桔潜叶蛾 (*Phyllocnistis citrella*)、欧洲粉蝶 (*Pieris brassicae*)、苜蓿绿夜蛾 (*Plathypena scabra*)、菜蛾 (*Plutella xylostella*)、大豆夜蛾 (*Pseudoplusia includens*)、*Rhyacionia frustrana*、*Scrobipalpula absoluta*、麦蛾 (*Sitotroga cerealella*)、葡萄卷叶蛾 (*Sparganothis pilleriana*)、草地夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*)、海灰翅夜蛾 (*Spodoptera littoralis*)、斜纹夜蛾 (*Spodoptera litura*)、*Thaumtopoea pityocampa*、绿色橡木飞蛾 (*Tortrix viridana*)、粉纹夜蛾 (*Trichoplusia ni*) 和 *Zeiraphera canadensis*;

[1018] 甲虫 (鞘翅目 (*Coleoptera*)), 例如梨窄吉丁 (*Agrilus sinuatus*)、直条叩头虫 (*Agriotes lineatus*)、暗色叩头虫 (*Agriotes obscurus*)、*Amphimallus solstitialis*、*Anisandrus dispar*、墨西哥棉铃象 (*Anthonomus grandis*)、苹花象 (*Anthonomus pomorum*)、甜菜隐食甲 (*Atomaria linearis*)、纵坑切梢小蠹 (*Blastophagus piniperda*)、*Blitophaga undata*、蚕豆象 (*Bruchus rufimanus*)、豌豆象 (*Bruchus pisorum*)、欧洲兵豆象 (*Bruchus lentis*)、苹卷象 (*Byctiscus betulae*)、甜菜大龟甲 (*Cassida nebulosa*)、*Cerotoma trifurcata*、白菜籽龟象 (*Ceuthorrhynchus assimilis*)、芜菁龟象 (*Ceuthorrhynchus napi*)、甜菜胫跳甲 (*Chaetocnema tibialis*)、*Conoderus vespertinus*、石刁柏负泥虫 (*Crioceris asparagi*)、长角叶甲 (*Diabrotica longicornis*)、*Diabrotica 12-punctata*、玉米根叶甲 (*Diabrotica virgifera*)、墨西哥豆瓢虫 (*Epilachna varivestis*)、烟草跳甲 (*Epitrix hirtipennis*)、棉灰蒙象变种 (*Eutinobothrus brasiliensis*)、欧洲松树皮象 (*Hylobius abietis*)、埃及苜蓿叶象 (*Hypera brunneipennis*)、紫苜蓿叶象 (*Hypera postica*)、云杉八齿小蠹 (*Ips typographus*)、烟草负泥虫 (*Lema bilineata*)、黑角负泥虫 (*Lema melanopus*)、马铃薯叶甲 (*Leptinotarsa decemlineata*)、*Limonius californicus*、稻水象甲 (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、*Melanotus communis*、油菜露尾甲 (*Meligethes aeneus*)、大栗鳃金龟 (*Melolontha hippocastani*)、五月鳃金龟 (*Melolontha melolontha*)、水稻负泥虫 (*Oulema oryzae*)、葡萄黑耳喙象 (*Ortiorrhynchus sulcatus*)、草莓根象甲 (*Otiorrhynchus ovatus*)、辣根猿叶甲 (*Phaedon cochleariae*)、*Phyllotreta chrysocephala*、食叶鳃金龟属 (*Phyllophaga* sp.)、庭园发丽金龟 (*Phyllopertha horticola*)、大豆淡足跳甲 (*Phyllotreta nemorum*)、黄曲条菜跳甲 (*Phyllotreta striolata*)、日本金龟子 (*Popillia japonica*)、豌豆叶象 (*Sitona lineatus*) 和谷象 (*Sitophilus granaria*);

[1019] 双翅目昆虫 (双翅目 (*Diptera*)), 例如埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*)、刺扰伊蚊 (*Aedes vexans*)、墨西哥果蝇 (*Anastrepha ludens*)、五斑按蚊 (*Anopheles maculipennis*)、地中海实蝇 (*Ceratitis capitata*)、蛆症金蝇 (*Chrysomya bezziana*)、*Chrysomya hominivorax*、*Chrysomya macellaria*、高粱瘿蚊 (*Contarinia sorghicola*)、*Cordylobia anthropophaga*、尖音库蚊 (*Culex pipiens*)、瓜蝇 (*Dacus cucurbitae*)、油橄榄实蝇 (*Dacus oleae*)、油菜叶瘿蚊 (*Dasineura brassicae*)、小毛厕蝇 (*Fannia canicularis*)、马蝇 (*Gasterophilus intestinalis*)、刺舌蝇 (*Glossina morsitans*)、*Haematobia irritans*、*Haplodiplosis equestris*、花生田灰地种蝇 (*Hylemyia platura*)、

纹皮蝇 (*Hypoderma lineata*)、蔬菜斑潜蝇 (*Liriomyza sativae*)、美国潜叶蝇 (*Liriomyza trifolii*)、*Lucilia caprina*、铜绿蝇 (*Lucilia cuprina*)、丝光绿蝇 (*Lucilia sericata*)、*Lycoria pectoralis*、麦瘿蚊 (*Mayetiola destructor*)、家蝇 (*Musca domestica*)、厩腐蝇 (*Muscina stabulans*)、羊狂蝇 (*Oestrus ovis*)、欧洲麦秆蝇 (*Oscinella frit*)、天仙子泉蝇 (*Pegomya hysocyami*)、*Phorbia antiqua*、萝卜蝇 (*Phorbia brassicae*)、*Phorbia coarctata*、樱桃实蝇 (*Rhagoletis cerasi*)、苹果实蝇 (*Rhagoletis pomonella*)、牛虻 (*Tabanus bovinus*)、*Tipula oleracea* 和欧洲大蚊 (*Tipula paludosa*)；

[1020] 蓟马 (缨翅目 (*Thysanoptera*)), 例如兰花蓟马 (*Dichromothrips corbetti*)、烟褐蓟马 (*Frankliniella fusca*)、苜蓿花蓟马 (*Frankliniella occidentalis*)、东方花蓟马 (*Frankliniella tritici*)、桔梗蓟马 (*Scirtothrips citri*)、稻蓟马 (*Thrips oryzae*)、棕榈蓟马 (*Thrips palmi*) 和烟蓟马 (*Thrips tabaci*)；

[1021] 膜翅目昆虫 (膜翅目 (*Hymenoptera*)), 例如新疆菜叶蜂 (*Athalia rosae*)、切叶蚁 (*Atta cephalotes*)、*Atta sexdens*、*Atta texana*、*Hoplocampa minuta*、*Hoplocampa testudinea*、小黄家蚁 (*Monomorium pharaonis*)、热带火蚁 (*Solenopsis geminate*) 和红火蚁 (*Solenopsis invicta*)；

[1022] 异翅目昆虫 (异翅目 (*Heteroptera*)), 例如拟绿蝽 (*Acrosternum hilare*)、玉米长蝽 (*Blissus leucopterus*)、黑斑烟盲蝽 (*Cyrtopeltis notatus*)、棉红蝽 (*Dysdercus cingulatus*)、*Dysdercus intermedius*、麦扁盾蝽 (*Eurygaster integriceps*)、烟草蝽 (*Euschistus impictiventris*)、棉红铃喙缘蝽 (*Leptoglossus phyllopus*)、美洲牧草盲蝽 (*Lygus lineolaris*)、牧草盲蝽 (*Lygus pratensis*)、稻绿蝽 (*Nezara viridula*)、甜菜拟网蝽 (*Piesma quadrata*)、*Solubea insularis* 和 *Thyanta perditor*；

[1023] 同翅目昆虫 (同翅目 (*Homoptera*)), 例如 *Acyrtosiphon onobrychis*、落叶松球蚜 (*Adelges laricis*)、*Aphidula nasturtii*、甜菜蚜 (*Aphis fabae*)、草莓根蚜 (*Aphis forbesi*)、苹果蚜 (*Aphis pomi*)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)、北美茶藨子蚜 (*Aphis grossulariae*)、*Aphis schneideri*、卷叶蚜 (*Aphis spiraecola*)、*Aphis sambuci*、豌豆蚜 (*Acyrtosiphon pisum*)、马铃薯蚜 (*Aulacorthum solani*)、银叶粉虱 (*Bemisia argentifolii*)、烟粉虱 (*Bemisia tabaci*)、*Brachycaudus cardui*、杏圆尾蚜 (*Brachycaudus helichrysi*)、*Brachycaudus persicae*、*Brachycaudus prunicola*、甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*)、*Capitophorus horni*、*Cerosipha gossypii*、*Chaetosiphon fragaefolii*、*Cryptomyzus ribis*、高加索冷杉椎球蚜 (*Dreyfusia nordmannianae*)、云杉椎球蚜 (*Dreyfusia piceae*)、居根西圆尾蚜 (*Dysaphis radicola*)、*Dysaulacorthum pseudosolani*、*Dysaphis plantaginea*、*Dysaphis pyri*、蚕豆微叶蝉 (*Empoasca fabae*)、桃大尾蚜 (*Hyalopterus pruni*)、*Hyperomyzus lactucae*、麦长管蚜 (*Macrosiphum avenae*)、大戟长管蚜 (*Macrosiphum euphorbiae*)、蔷薇管蚜 (*Macrosiphon rosae*)、*Megoura viciae*、巢菜修尾蚜 (*Melanaphis pyrae*)、麦无网蚜 (*Metopolophium dirhodum*)、*Myzodes persicae*、冬葱瘤额蚜 (*Myzus ascalonicus*)、*Myzus cerasi*、桃蚜 (*Myzus persicae*)、李瘤蚜 (*Myzus varians*)、*Nasonovia ribis-nigri*、稻飞虱 (*Nilaparvata lugens*)、囊柄瘿绵蚜 (*Pemphigus bursarius*)、蔗飞虱 (*Perkinsiella saccharicida*)、忽布疣蚜 (*Phorodon humuli*)、苹木虱 (*Psylla mali*)、梨木虱 (*Psylla pyri*)、冬葱

瘤蛾蚜 (*Rhopalomyzus ascalonicus*)、玉米蚜 (*Rhopalosiphum maidis*)、禾谷溢管蚜 (*Rhopalosiphum padi*)、*Rhopalosiphum insertum*、*Sappaphis mala*、*Sappaphis mali*、麦二叉蚜 (*Schizaphis graminum*)、*Schizoneura lanuginosa*、麦长管蚜 (*Sitobion avenae*)、白背飞虱 (*Sogatella furcifera*)、白粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*)、*Toxoptera aurantii* 和葡萄根瘤蚜 (*Viteus vitifolii*)；

[1024] 白蚁 (等翅目 (Isoptera))，例如 *Calotermes flavicollis*、*Leucotermes flavipes*、黄肢散白蚁 (*Reticulitermes flavipes*)、欧洲散白蚁 (*Reticulitermes lucifugus*) 和 *Termes natalensis*；

[1025] 直翅目昆虫 (直翅目 (Orthoptera))，例如居屋艾蟋 (*Acheta domestica*)、东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*)、德国小蠊 (*Blattella germanica*)、欧洲球螋 (*Forficula auricularia*)、蝼蛄 (*Gryllotalpa gryllotalpa*)、飞蝗 (*Locusta migratoria*)、双纹黑蝗 (*Melanoplus bivittatus*)、红足黑蝗 (*Melanoplus femur-rubrum*)、墨西哥黑蝗 (*Melanoplus mexicanus*)、迁飞黑蝗 (*Melanoplus sanguinipes*)、石栖黑蝗 (*Melanoplus spretus*)、条纹红蝗 (*Nomadacris septemfasciata*)、美洲蟑螂 (*Periplaneta americana*)、美洲沙漠蝗 (*Schistocerca americana*)、*Schistocerca peregrina*、*Stauronotus maroccanus* 和庭疾灶螽 (*Tachycines asymamorus*)，

[1026] 蜘蛛纲 (Arachnoidea)，如蜘蛛 (蜱螨目 (Acarina))，例如软蜱科 (*Argasidae*)、硬蜱科 (*Ixodidae*) 和疥螨科 (*Sarcoptidae*)，如长星形壁虱 (*Amblyomma americanum*)、热带花蜱 (*Amblyomma variegatum*)、波斯锐缘蜱 (*Argas persicus*)、牛壁虱 (*Boophilus annulatus*)、*Boophilus decoloratus*、微小牛蜱 (*Boophilus microplus*)、*Dermacentor silvarum*、*Hyalomma truncatum*、蓖子硬蜱 (*Ixodes ricinus*)、*Ixodes rubicundus*、*Ornithodoros moubata*、*Otobius megnini*、鸡皮刺螨 (*Dermanyssus gallinae*)、绵羊疥病 (*Psoroptes ovis*)、*Rhipicephalus appendiculatus*、*Rhipicephalus evertsi*、人疥螨 (*Sarcoptes scabiei*)、瘰螨属 (*Eriophyidae*)，如苹果刺锈螨 (*Aculus schlechtendali*)、*Phyllocoptrata oleivora* 和 *Eriophyes sheldoni*；细螨属 (*Tarsonemidae*)，如 *Phytonemus pallidus* 和侧多食跗线螨 (*Polyphagotarsonemus latus*)；细须螨属 (*Tenuipalpidae*)，如紫红短须螨 (*Brevipalpus phoenicis*)；叶螨属 (*Tetranychidae*)，如朱砂叶螨 (*Tetranychus cinnabarinus*)、神泽叶螨 (*Tetranychus kanzawai*)、太平洋叶螨 (*Tetranychus pacificus*)、棉叶螨 (*Tetranychus telarius*) 和二点叶螨 (*Tetranychus urticae*)、苹果叶螨 (*Panonychus ulmi*)、柑桔叶螨 (*Panonychus citri*) 和 *oligonychus pratensis*；

[1027] 蚤目 (Siphonatera)，例如印鼠客蚤 (*Xenopsylla cheopsis*)、角叶属 (*Ceratophyllus*)。

[1028] 组合物和式 I 化合物可用于防治线虫，尤其是植物寄生线虫如根结线虫，北方根结线虫 (*Meloidogyne hapla*)、南方根结线虫 (*Meloidogyne incognita*)、爪哇根结线虫 (*Meloidogyne javanica*) 和其他根结线虫属 (*Meloidogyne*)；形成胞囊的线虫，马铃薯金线虫 (*Globodera rostochiensis*) 和其他球胞囊属 (*Globodera*)；禾谷胞囊线虫 (*Heterodera avenae*)、大豆胞囊线虫 (*Heterodera glycines*)、甜菜胞囊线虫 (*Heterodera schachtii*)、三叶草胞囊线虫 (*Heterodera trifolii*) 和其他胞囊线虫属 (*Heterodera*)；

种子肿囊线虫,粒线虫属 (*Anguina*) ;茎叶线虫,滑刃线虫属 (*Aphelenchoides*) ;刺线虫,杂草刺线虫 (*Belonolaimus longicaudatus*) 和其他针刺线虫属 (*Belonolaimus*) ;松线虫,松材线虫 (*Bursaphelenchus xylophilus*) 和其他伞滑刃线虫属 (*Bursaphelenchus*) ;环形线虫,环纹线虫属 (*Criconema*)、小环线虫属 (*Criconemella*)、轮线虫属 (*Criconemoides*)、中环线虫属 (*Mesocriconema*) ;球茎线虫,腐烂茎线虫 (*Ditylenchus destructor*)、甘薯茎线虫 (*Ditylenchus dipsaci*) 和其他茎线虫属 (*Ditylenchus*) ;锥线虫,锥线虫属 (*Dolichodorus*) ;螺旋形线虫,*Heliocotylenchus multicinctus* 和其他 *Helicotylenchus* 属;鞘线虫和鞘形 (sheathoid) 线虫,鞘线虫属 (*Hemicyclophora*) 和 *Hemicriconemoides* 属;*Hirshmanniella* 属;冠线虫, *Hoploaimus* 属;伪根结线虫,珍珠线虫属 (*Nacobbus*) ;针线虫, *Longidorus elongatus* 和其他长针线虫属 (*Longidorus*) ;鞘线虫,针线虫属 (*Paratylenchus*) ;根腐线虫, *Pratylenchus neglectus*、穿刺根腐线虫 (*Pratylenchus penetrans*)、*Pratylenchus curvatus*、*Pratylenchus goodeyi* 和其他根腐线虫属 (*Pratylenchus*) ;穿孔线虫,香蕉穿孔线虫 (*Radopholus similis*) 和其他穿孔线虫属 (*Radopholus*) ;肾形线虫, *Rotylenchus robustus* 和其他盘旋线虫属 (*Rotylenchus*) ;*Scutellonema* 属;残根线虫, *Trichodorus primitivus* 和其他毛刺线虫属 (*Trichodorus*)、拟毛刺属 (*Paratrichodorus*) ;阻长线虫, *Tylenchorhynchus claytoni*、*Tylenchorhynchus dubius* 和其他矮化线虫属 (*Tylenchorhynchus*) ;柑桔线虫,垫刃线虫属 (*Tylenchulus*) ;剑线虫,剑线虫属 (*Xiphinema*) ;以及其他植物寄生线虫。

[1029] 在本发明的优选实施方案中,将式 I 化合物用于防治昆虫或蜘蛛,尤其是鳞翅目、鞘翅目、缨翅目和同翅目昆虫以及蜱螨目蜘蛛。本发明的式 I 化合物特别可以用于防治缨翅目和同翅目昆虫。

[1030] 式 I 化合物或包含它们的杀虫组合物可以通过使植物 / 作物与杀虫有效量的式 I 化合物接触而用于保护生长的植物和作物以防无脊椎动物害虫,尤其是昆虫、螨科 (*acaridae*) 或蜘蛛侵袭或侵染。本文所用术语“作物”指生长和收获的作物二者。

[1031] 可以将式 I 化合物转化成常规配制剂,例如溶液、乳液、悬浮液、粉剂、粉末、糊和颗粒。使用形式取决于特定的意欲目的;在每种情况下应确保本发明化合物精细和均匀地分布。

[1032] 配制剂以已知方式制备 (对于综述例如参见 US 3,060,084, EP-A 707 445 (对于液体浓缩物), Browning, “Agglomeration”, Chemical Engineering, 1967 年 12 月 4 日, 147-48, Perry' s Chemical Engineer' s Handbook, 第 4 版, McGraw-Hill, New York, 1963, 第 8-57 页及随后各页, WO 91/13546, US 4,172,714, US 4,144,050, US 3,920,442, US 5,180,587, US 5,232,701, US 5,208,030, GB 2,095,558, US 3,299,566, Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, Hance 等, Weed Control Handbook, 第 8 版, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 和 Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (德国), 2001, 2. D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN0-7514-0443-8), 例如通过将活性化化合物与适合配制农用化学品的助剂如溶剂和 / 或载体,需要的话乳化剂、表面活性剂和分散剂、防腐剂、消泡剂、防冻剂、用于种子处理配制剂还有任选的着色剂和 / 或粘合剂和 / 或

胶凝剂混合而制备。

[1033] 合适溶剂的实例为水、芳族溶剂（例如 Solvesso 产品、二甲苯）、石蜡（如矿物油馏分）、醇类（如甲醇、丁醇、戊醇、苄醇）、酮类（如环己酮、 γ -丁内酯）、吡咯烷酮（N-甲基吡咯烷酮 [NMP]、N-辛基吡咯烷酮 [NOP]）、乙酸酯（乙二醇二乙酸酯）、二元醇、脂肪酸二甲基酰胺、脂肪酸及脂肪酸酯。原则上还可以使用溶剂混合物。

[1034] 合适乳化剂为非离子和阴离子乳化剂（例如聚氧乙烯脂肪醇醚、烷基磺酸盐和芳基磺酸盐）。

[1035] 分散剂的实例是木素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

[1036] 所用的合适表面活性剂是木素磺酸、萘磺酸、苯酚磺酸、二丁基萘磺酸的碱金属盐、碱土金属盐和铵盐，烷基芳基磺酸盐，烷基硫酸盐，烷基磺酸盐，脂肪醇硫酸盐，脂肪酸和硫酸化脂肪醇乙二醇醚，还有磺化萘和萘衍生物与甲醛的缩合物，萘或萘磺酸与苯酚和甲醛的缩合物，聚氧乙烯辛基酚醚，乙氧基化的异辛基酚、辛基酚、壬基酚，烷基酚聚乙二醇醚，三丁基苯基聚乙二醇醚，三硬脂基苯基聚乙二醇醚，烷基芳基聚醚醇，醇和脂肪醇/氧化乙烯缩合物，乙氧基化蓖麻油，聚氧乙烯烷基醚，乙氧基化聚氧丙烯，月桂醇聚乙二醇醚缩醛，山梨醇酯，木素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

[1037] 适于制备可直接喷雾溶液、乳液、糊或油分散体的物质是中沸点至高沸点的矿物油馏分，如煤油或柴油，此外还有煤焦油和植物或动物来源的油，脂族、环状和芳族烃，例如甲苯、二甲苯、石蜡、四氢化萘、烷基化萘或其衍生物、甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、环己醇、环己酮、异佛尔酮，强极性溶剂，例如二甲亚砜、N-甲基吡咯烷酮或水。

[1038] 还可以将防冻剂如甘油、乙二醇、丙二醇和杀菌剂加入配制剂中。

[1039] 合适的消泡剂例如为基于硅或硬脂酸镁的消泡剂。

[1040] 合适的防腐剂例如为二氯芬。

[1041] 种子处理配制剂可以额外包含粘合剂和任选的着色剂。

[1042] 可以加入粘合剂以改进处理之后活性物质在种子上的粘附。合适的粘合剂是嵌段共聚物、EO/PO 表面活性剂以及聚乙烯醇、聚乙烯基吡咯烷酮、聚丙烯酸酯、聚甲基丙烯酸酯、聚丁烯、聚异丁烯、聚苯乙烯、聚乙烯胺、聚乙烯酰胺、聚乙烯亚胺 (**Lupasol[®]**、**Polymin[®]**)、聚醚、聚氨酯、聚乙酸乙烯酯、纤维素酸钠以及衍生于这些聚合物的共聚物。

[1043] 任选还可以在配制剂中包括着色剂。对种子处理配制剂合适的着色剂或染料是若丹明 B、C. I. 颜料红 112、C. I. 溶剂红 1、颜料蓝 15:4、颜料蓝 15:3、颜料蓝 15:2、颜料蓝 15:1、颜料蓝 80、颜料黄 1、颜料黄 13、颜料红 112、颜料红 48:2、颜料红 48:1、颜料红 57:1、颜料红 53:1、颜料橙 43、颜料橙 34、颜料橙 5、颜料绿 36、颜料绿 7、颜料白 6、颜料棕 25、碱性紫 10、碱性紫 49、酸性红 51、酸性红 52、酸性红 14、酸性蓝 9、酸性黄 23、碱性红 10、碱性红 108。

[1044] 胶凝剂的实例是角叉菜 (**Satiagel[®]**)。

[1045] 粉末、撒播用材料和可撒粉产品可以通过将活性物质与固体载体混合或同时研磨而制备。

[1046] 颗粒如涂覆颗粒、浸渍颗粒和均质颗粒可以通过将活性化合物与固体载体粘附而

制备。

[1047] 固体载体的实例是矿土如硅胶、硅酸盐、滑石、高岭土、活性粘土 (attaclay)、石灰石、石灰、白垩、红玄武土、黄土、粘土、白云石、硅藻土、硫酸钙、硫酸镁、氧化镁；磨碎的合成材料；肥料如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、脲类；植物来源的产品如谷粉、树皮粉、木粉和坚果壳粉，纤维素粉和其他固体载体。

[1048] 配制剂通常包含 0.01-95 重量%，优选 0.1-90 重量% 活性化合物。此时，活性化合物以 90-100 重量%，优选 95-100 重量% 的纯度（根据 NMR 光谱）使用。

[1049] 对于种子处理目的，相应配制剂可以稀释 2-10 倍，从而在即用制剂中得到 0.01-60 重量%，优选 0.1-40 重量% 的活性化合物浓度。

[1050] 式 I 化合物可以直接、以其配制剂形式或由其制备的使用形式（如可直接喷雾溶液、粉末、悬浮液或分散体、乳液、油分散体、糊、可撒粉产品、撒播用材料或颗粒形式），借助喷雾、雾化、撒粉、撒播或浇灌来使用。使用形式完全取决于意欲的目的；在任何情况下意欲确保本发明活性化合物的最佳可能分布。

[1051] 含水使用形式可通过加入水由乳液浓缩物、糊或可湿性粉末（可喷雾粉末、油分散体）制备。为制备乳液、糊或油分散体，可借助润湿剂、增粘剂、分散剂或乳化剂将该物质直接或溶于油或溶剂中后在水中均化。然而，还可以制备由活性物质、润湿剂、增粘剂、分散剂或乳化剂以及合适的话溶剂或油构成的浓缩物且该浓缩物适于用水稀释。

[1052] 即用制剂中的活性化合物浓度可在较宽范围内变化。它们通常为 0.0001-10 重量%，优选 0.01-1 重量%。

[1053] 活性化合物也可成功用于超低容量法 (ULV)，其中可以施用包含超过 95 重量% 活性化合物的配制剂，或甚至施用不含添加剂的活性化合物。

[1054] 下列为配制剂实例：

[1055] 1. 叶面施用的用水稀释的产品。对于种子处理目的，该类产品的可以稀释或不加稀释地施用于种子。

[1056] A) 水溶性浓缩物 (SL、LS)

[1057] 将 10 重量份活性化合物溶于 90 重量份水或水溶性溶剂中。或者，加入润湿剂或其他助剂。活性化合物经水稀释溶解，从而得到含 10 重量% 活性化合物的配制剂。

[1058] B) 分散性浓缩物 (DC)

[1059] 将 20 重量份活性化合物溶于 70 重量份环己酮中并加入 10 重量份分散剂如聚乙烯基吡咯烷酮。用水稀释得到分散体，从而得到含有 20 重量% 活性化合物的配制剂。

[1060] C) 可乳化浓缩物 (EC)

[1061] 将 15 重量份活性化合物溶于 7 重量份二甲苯中并加入十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物（在每种情况下为 5 重量份）。用水稀释得到乳液，从而得到含有 15 重量% 活性化合物的配制剂。

[1062] D) 乳液 (EW、EO、ES)

[1063] 将 25 重量份活性化合物溶于 35 重量份二甲苯中并加入十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物（在每种情况下为 5 重量份）。借助乳化机（例如 Ultraturrax）将该混合物引入 30 重量份水中并制成均相乳液。用水稀释得到乳液，从而得到含有 25 重量% 活性化合物的配制剂。

[1064] E) 悬浮液 (SC、OD、FS)

[1065] 在搅拌的球磨机中,将 20 重量份活性化合物粉碎并加入 10 重量份分散剂、润湿剂和 70 重量份水或有机溶剂,得到细碎活性化合物悬浮液。用水稀释得到稳定的活性化合物悬浮液,从而得到含有 20 重量 % 活性化合物的配制剂。

[1066] F) 水分散性颗粒和水溶性颗粒 (WG、SG)

[1067] 将 50 重量份活性化合物细碎研磨并加入 50 重量份分散剂和润湿剂,借助工业装置(如挤出机、喷雾塔、流化床)将其制成水分散性或水溶性颗粒。用水稀释得到稳定的活性化合物分散体或溶液,从而得到含有 50 重量 % 活性化合物的配制剂。

[1068] G) 水分散性粉末和水溶性粉末 (WP、SP、SS、WS)

[1069] 将 75 重量份活性化合物在转子-定子磨机中研磨并加入 25 重量份分散剂、润湿剂和硅胶。用水稀释得到稳定的活性化合物分散体或溶液,从而得到含有 75 重量 % 活性化合物的配制剂。

[1070] H) 凝胶配制剂 (GF)

[1071] 在搅拌的球磨机中将 20 重量份活性化合物研磨,加入 10 重量份分散剂、1 重量份胶凝剂润湿剂和 70 重量份水或有机溶剂,得到细活性化合物悬浮液。用水稀释得到活性化合物的稳定悬浮液,从而得到活性化合物含量为 20 重量 % 的配制剂。

[1072] 2. 叶面施用的不经稀释而施用的产品。对于种子处理目的,该类产品可以稀释或不加稀释地施用于种子。

[1073] I) 可撒粉粉末 (DP、DS)

[1074] 将 5 重量份活性化合物细碎研磨并与 95 重量份细碎高岭土充分混合。这得到含有 5 重量 % 活性化合物的可撒粉产品。

[1075] J) 颗粒 (GR、FG、GG、MG)

[1076] 将 0.5 重量份活性化合物细碎研磨并结合 95.5 重量份载体,从而得到含有 0.5 重量 % 活性化合物的配制剂。现行方法是挤出、喷雾干燥或流化床方法。这得到叶面使用的不经稀释而施用的颗粒。

[1077] K) ULV 溶液 (UL)

[1078] 将 10 重量份活性化合物溶于 90 重量份有机溶剂如二甲苯中。这得到含有 10 重量 % 活性化合物的产品,其不经稀释而施用于叶面。

[1079] 式 I 化合物还适合处理植物繁殖材料(如种子)。常规的种子处理配制剂包括例如可流动浓缩物 FS、溶液 LS、干处理用粉末 DS、淤浆处理用水分散性粉末 WS、水溶性粉末 SS 以及乳液 ES 和 EC 及凝胶配制剂 GF。这些配制剂可以经稀释或不经稀释地施用于种子。施用于种子在播种之前直接对种子或在后者预萌发之后进行。

[1080] 在优选实施方案中,将 FS 配制剂用于种子处理。FS 配制剂通常可以包含 1-800g/1 活性成分,1-200g/1 表面活性剂,0-200g/1 防冻剂,0-400g/1 粘合剂,0-200g/1 颜料和至多 1 升溶剂,优选水。

[1081] 用于种子处理的式 I 化合物的其他优选 FS 配制剂包含 0.5-80 重量 % 活性成分,0.05-5 重量 % 润湿剂,0.5-15 重量 % 分散剂,0.1-5 重量 % 增稠剂,5-20 重量 % 防冻剂,0.1-2 重量 % 消泡剂,1-20 重量 % 颜料和 / 或染料,0-15 重量 % 粘着剂 / 粘附剂,0-75 重量 % 填料 / 赋形剂和 0.01-1 重量 % 防腐剂。

[1082] 各种类型的油、润湿剂、辅助剂、除草剂、杀真菌剂、其他杀虫剂或杀菌剂都可加入活性成分中,若合适的话,恰在紧临使用前加入(桶混合)。这些试剂通常与本发明试剂以1:10-10:1的重量比混合。

[1083] 式 I 化合物通过接触(经由土壤、玻璃、墙壁、床网、地毯、植物部分或动物部分)和摄取(诱饵或植物部分)而有效。

[1084] 为了用于蚂蚁、白蚁、黄蜂、蝇、蚊子、蟋蟀或蟑螂,优选将式 I 化合物用于诱饵组合中。

[1085] 诱饵可以是液体、固体或半固体制剂(例如凝胶)。固体诱饵可以制成各种适合相应应用的形状和形式,如颗粒、块、棒、片。液体诱饵可以填充到各种装置中以确保适当施用,例如敞开容器、喷雾装置、液滴供应源或蒸发源。凝胶可以基于含水基质或油性基质且可以按照粘性、水分保留或老化特性根据特定要求配制。

[1086] 用于组合物中的诱饵是具有足够的吸引力以刺激诸如蚂蚁、白蚁、黄蜂、蝇、蚊子、蟋蟀等的昆虫或蟑螂食用它的产品。吸引力可以通过使用进食刺激剂或性信息素调控。食物刺激剂例如并不穷举地选自动物和/或植物蛋白质(肉-、鱼-或血液膳食,昆虫部分、蛋黄)、动物和/或植物来源的脂肪和油或单-、低聚-或聚有机糖类,尤其是蔗糖、乳糖、果糖、右旋糖、葡萄糖、淀粉、果胶或甚至糖蜜或蜂蜜。水果、作物、植物、动物、昆虫的新鲜或腐败部分或其特定部分也可以用作进食刺激剂。已知性信息素更具昆虫特异性。特殊信息素描述于文献中并且对本领域熟练技术人员是已知的。

[1087] 式 I 化合物的配制剂如气雾剂(例如在喷雾罐中)、油喷雾剂或泵喷雾剂高度适于非专业使用者来防治害虫如蝇、跳蚤、蜱、蚊子或蟑螂。气雾剂配方优选由如下组分构成:活性化合物;溶剂如低级醇(例如甲醇、乙醇、丙醇、丁醇),酮类(例如丙酮、甲基乙基酮),沸程为约 50-250°C 的链烷烃(例如煤油),二甲基甲酰胺, N- 甲基吡咯烷酮,二甲亚砜,芳族烃类如甲苯、二甲苯,水;此外还有助剂,例如乳化剂如山梨糖醇单油酸酯、具有 3-7mol 氧化乙烯的油基乙氧基化物、脂肪醇乙氧基化物,芳香油如精油,中等脂肪酸与低级醇的酯,芳族羰基化合物;合适的话还有稳定剂如苯甲酸钠,两性表面活性剂,低级环氧化物,原甲酸三乙酯和需要的话推进剂如丙烷、丁烷、氮气、压缩空气、二甲醚、二氧化碳、氧化亚氮或这些气体的混合物。

[1088] 油喷雾配制剂与气雾剂配方的不同在于没有使用推进剂。

[1089] 式 I 化合物及其相应的组合物还可以用于蚊香片和熏蒸片,发烟盒、蒸发器板或长效蒸发器以及扑蛾纸、扑蛾垫或其他与热无关的蒸发器体系中。

[1090] 用式 I 化合物及其相应组合物控制由昆虫传递的传染性疾病(例如疟疾、登革热和黄热病,淋巴丝虫病以及利什曼病)的方法也包括处理棚屋和房子的表面、空气喷雾和浸渍窗帘、帐篷、衣物、床品、采采蝇网等。施用于纤维、织物、编织物、无纺织物、网状材料或箔以及篷布上的杀虫组合物优选包含包括杀虫剂、任选的驱除剂和至少一种粘合剂的混合物。合适的驱除剂例如为 N, N- 二乙基-间甲苯甲酰胺(DEET), N, N- 二乙基苯基乙酰胺(DEPA), 1-(3-环己烷-1-基羰基)-2-甲基哌啶, (2-羟基甲基环己基)乙酸内酯, 2-乙基-1, 3-己二醇, 避虫酮, 甲基新癸酰胺(MNDA), 不用于昆虫防治的拟除虫菊酯如 {(+/-)-3-烯丙基-2-甲基-4-氧代环戊-2-(+)-烯基-(+)-反式-菊酸酯(Esbiothrin), 衍生于植物提取物或与植物提取物相同的驱除剂如 1, 8-萜二烯、

丁子香酚、(+)-Eucamalol(1)、(-)-1-表-eucamalol,或来自诸如花皮桉(*Eucalyptus maculata*)、蔓荆(*Vitex rotundifolia*)、Cymbopogon martinii、香茅(*Cymbopogon citratus*) (柠檬草)、亚香茅(*Cymbopogon nardus* (香茅))的植物的粗植物提取物。合适的粘合剂例如选自如下单体的聚合物和共聚物:脂族酸的乙烯基酯(如乙酸乙烯酯和支链烷烃羧酸乙烯基酯),醇的丙烯酸酯和甲基丙烯酸酯,如丙烯酸丁酯、丙烯酸 2-乙基己基酯和丙烯酸甲酯,单烯属和二烯属不饱和烃,如苯乙烯,以及脂族二烯烃,如丁二烯。

[1091] 窗帘和床品的浸渍通常通过将纺织材料浸入式 I 的活性化合物的乳液或分散体中或将它们喷雾于床品上而进行。

[1092] 可以用于处理种子的方法原则上是所有本领域已知的合适种子处理技术,尤其是拌种技术,如种子涂敷(例如种子压丸)、种子撒粉和种子吸液(例如种子浸泡)。这里“种子处理”指所有使种子和式 I 化合物相互接触的方法,而“拌种”指为种子提供一定量式 I 化合物的种子处理方法,即产生包含式 I 化合物的种子的方法。原则上可以在从种子收获到种子播种的任何时间对种子进行处理。种子可以在紧临种子的播种之前或在其中处理,例如使用“播种箱”方法。然而,还可以在播种之前几个星期或几个月,例如播种之前至多 12 个月进行处理,例如以拌种处理形式进行,此时没有观察到效力显著降低。

[1093] 有利的是,对未播种的种子进行处理。本文所用术语“未播种的种子”意欲包括从种子收获到为萌发和植物生长的目的而在地中播种种子的任何时间段的种子。

[1094] 具体而言,在处理中采取如下程序:在合适的装置如用于固体或固体/液体混合配对的混合装置中将种子与所需量的种子处理配制剂直接或在预先用水稀释之后混合,直到组合物均匀分布于种子上。合适的话,然后进行干燥步骤。

[1095] 活性化合物可以单独或者以与增效剂或对抗病原性体内和体外寄生虫的其他活性化合物的混合物施用。

[1096] 例如,式 I 的活性化合物可以以与合成球虫病化合物,聚醚抗生素类如安普罗利、罗贝胍、托曲珠利、莫能菌素、盐霉素、马杜霉素、拉沙里菌素、甲基盐霉素或生度米星或在下面的列举 M 中所述的其他农药的混合物施用。

[1097] 根据本发明使用的组合物还可以含有其他活性成分,例如其他农药、杀虫剂、除草剂、杀真菌剂、其他杀虫剂或杀菌剂,肥料如硝酸铵、尿素、钾碱和过磷酸钙,植物毒素和植物生长调节剂、安全剂和杀线虫剂。这些额外成分可以与上述组合物依次或结合使用,合适的话还在紧临使用前加入(桶混物)。例如可以在用其他活性成分处理之前或之后用本发明组合物喷雾植物。

[1098] 这些试剂可以 1:10-10:1 的重量比与本发明所用试剂混合。将作为杀虫剂使用的式 I 化合物或包含它们的组合物与其他农药混合通常导致更宽的杀虫作用谱。

[1099] 本发明式 I 化合物可以与其一起使用并且可能产生潜在的协同增效作用的下列农药 M 用来说明可能的组合,但不施加任何限制:

[1100] M. 1. 有机(硫代)磷酸酯化合物:高灭磷(acephate)、唑啉磷(azamethiphos)、乙基谷硫磷(azinphos-ethyl)、谷硫磷(azinphos-methyl)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、毒虫畏(chlorfenvinphos)、氯甲硫磷(chlormephos)、毒死蜱(chlorpyrifos)、甲基毒死蜱(chlorpyrifos-methyl)、蝇毒磷(coumaphos)、杀螟腈(cyanophos)、甲基内吸磷(demeton-S-methyl)、二嗪农(diazinon)、敌敌畏(dichlorvos/DDVP)、百

治磷 (dicrotophos)、乐果 (dimethoate)、甲基毒虫畏 (dimethylvinphos)、乙拌磷 (disulfoton)、EPN、乙硫磷 (ethion)、丙线磷 (ethoprophos)、伐灭磷 (famphur)、苯线磷 (fenamiphos)、杀螟松 (fenitrothion)、倍硫磷 (fenthion)、吡氟硫磷 (flupyrzophos)、噻唑硫磷 (fosthiazate)、庚烯磷 (heptenophos)、异噁唑磷 (isoxathion)、马拉硫磷 (malathion)、灭蚜磷 (mecarbam)、甲胺磷 (methamidophos)、杀扑磷 (methidathion)、速灭磷 (mevinphos)、久效磷 (monocrotophos)、二溴磷 (naled)、氧乐果 (omethoate)、砒吸磷 (oxydemeton-methyl)、一六零五 (parathion)、甲基对硫磷 (parathion-methyl)、稻丰散 (phenthoate)、甲拌磷 (phorate)、伏杀磷 (phosalone)、亚胺硫磷 (phosmet)、磷胺 (phosphamidon)、辛硫磷 (phoxim)、虫螨磷 (pirimiphos-methyl)、丙溴磷 (profenofos)、巴胺磷 (propetamphos)、丙硫磷 (prothiofos)、吡唑硫磷 (pyraclofos)、哒嗪硫磷 (pyridaphenthion)、喹硫磷 (quinalphos)、治螟磷 (sulfotep)、丁基嘧啶磷 (tebupirimfos)、双硫磷 (temephos)、特丁磷 (terbufos)、杀虫威 (tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷 (thiometon)、三唑磷 (triazophos)、敌百虫 (trichlorfon)、蚜灭磷 (vamidothion) ;

[1101] M. 2. 氨基甲酸酯化合物:涕灭威 (aldicarb)、棉铃威 (alanycarb)、噁虫威 (bendiocarb)、丙硫克百威 (benfuracarb)、丁酮威 (butocarboxim)、丁酮氧威 (butoxycarboxim)、甲萘威 (carbaryl)、虫螨威 (carbofuran)、丁硫克百威 (carbosulfan)、苯虫威 (ethiofencarb)、仲丁威 (fenobucarb)、抗螨脒 (formetanate)、呋线威 (furathiocarb)、异丙威 (isoprocarb)、灭虫威 (methiocarb)、灭多虫 (methomyl)、速灭威 (metolcarb)、甲氧叉威 (oxamyl)、抗蚜威 (pirimicarb)、残杀威 (propoxur)、硫双威 (thiodicarb)、久效威 (thiofanox)、混杀威 (trimethacarb)、XMC、灭杀威 (xylylcarb)、唑蚜威 (triazamate) ;

[1102] M. 3. 合成除虫菊酯化合物:氟丙菊酯 (acrinathrin)、丙烯除虫菊 (allethrin)、右旋丙烯菊酯 (d-cis-trans allethrin)、右旋反式丙烯菊酯 (d-trans allethrin)、氟氯菊酯 (bifenthrin)、生物烯丙菊酯 (bioallethrin)、2-环戊烯基生物烯丙菊酯 (bioallethrin S-cyclopentenyl)、生物苄呋菊酯 (bioresmethrin)、乙氰菊酯 (cycloprothrin)、氟氯氰菊酯 (cyfluthrin)、高效氟氯氰菊酯 (beta-cyfluthrin)、(RS) 氯氟氰菊酯 (cyhalothrin)、氯氟氰菊酯 (lambda-cyhalothrin)、精高效氯氟氰菊酯 (gamma-cyhalothrin)、氯氰菊酯 (cypermethrin)、甲体氯氰菊酯 (alpha-cypermethrin)、乙体氯氰菊酯 (beta-cypermethrin)、高效反式氯氰菊酯 (theta-cypermethrin)、己体氯氰菊酯 (zeta-cypermethrin)、苯醚氰菊酯 (cyphenothrin)、溴氰菊酯 (deltamethrin)、烯炔菊酯 (empenthrin)、高氰戊菊酯 (esfenvalerate)、醚菊酯 (etofenprox)、甲氰菊酯 (fenpropathrin)、杀灭菊酯 (fenvalerate)、氟氰戊菊酯 (flucythrinate)、氟氯苯菊酯 (flumethrin)、氟胺氰菊酯 (tau-fluvalinate)、溴氟醚菊酯 (halfenprox)、咪炔菊酯 (imiprothrin)、甲氧苄氟菊酯 (metofluthrin)、氯菊酯 (permethrin)、苯醚菊酯 (phenothrin)、炔酮菊酯 (prallethrin)、丙氟菊酯 (profluthrin)、除虫菊酯 (pyrethrin (除虫菊 (pyrethrum)))、灭虫菊 (resmethrin)、灭虫硅醚 (silafaluofen)、七氟菊酯 (tefluthrin)、胺菊酯 (tetramethrin)、四溴菊酯 (tralomethrin)、四氟菊酯

(transfluthrin) ;

[1103] M. 4. 保幼激素模拟物 : 蒙 512(hydroprene)、烯虫炔酯 (kinoprene)、蒙五一五 (methoprene)、双氧威 (fenoxycarb)、蚊蝇醚 (pyriproxyfen) ;

[1104] M. 5. 烟酸受体激动剂 / 拮抗剂化合物 : 吡虫清 (acetamiprid)、杀虫磺 (bensultap)、杀螟丹 (cartap hydrochloride)、噻虫胺 (clothianidin)、呋虫胺 (dinotefuran)、吡虫啉 (imidacloprid)、噻虫嗪 (thiamethoxam)、硝胺烯啶 (nitenpyram)、烟碱 (nicotine)、艾克敌 105 (spinosad) (别构激动剂)、乙基多杀菌素 (spinetoram) (别构激动剂)、噻虫啉 (thiacloprid)、杀虫环 (thiocyclam)、杀虫双 (thiosultap-sodium) 和 AKD 1022 ;

[1105] M. 6. GABA 门控氯离子通道拮抗剂化合物 : 氯丹 (chlordane)、硫丹 (endosulfan)、林丹 (gamma-HCH(lindane))、乙虫腈 (ethiprole)、锐劲特 (fipronil)、pyrafluprole 和 pyriprole ;

[1106] M. 7. 氯离子通道活化剂 : 齐墩螨素 (abamectin)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐 (emamectin benzoate)、米尔螨素 (milbemectin)、lepimectin ;

[1107] M. 8. METI I 化合物 : 喹螨醚 (fenazaquin)、唑螨酯 (fenpyroximate)、嘧螨醚 (pyrimidifen)、哒螨酮 (pyridaben)、吡螨胺 (tebufenpyrad)、唑虫酰胺 (tolfenpyrad)、嘧虫胺 (flufenimer)、鱼藤酮 (rotenone) ;

[1108] M. 9. METI II 和 III 化合物 : 灭螨醌 (acequinocyl)、fluacyprim、灭蚁腠 (hydramethylnon) ;

[1109] M. 10. 氧化磷酸化去偶剂 : 氟唑虫清 (chlorfenapyr)、二硝酚 (DNOC) ;

[1110] M. 11. 氧化磷酸化抑制剂 : 三唑锡 (azocyclotin)、三环锡 (cyhexatin)、杀螨硫隆 (diafenthiuron)、杀螨锡 (fenbutatin oxide)、克螨特 (propargite)、三氯杀螨砜 (tetradifon) ;

[1111] M. 12. 蜕皮干扰剂 : 灭蝇胺 (cyromazine)、环虫酰肼 (chromafenozide)、特丁苯酰肼 (halofenozide)、甲氧苯酰肼 (methoxyfenozide)、双苯酰肼 (tebufenozide) ;

[1112] M. 13. 增效剂 : 增效醚 (piperonyl butoxide)、脱叶磷 (tribufos) ;

[1113] M. 14. 钠通道阻断剂化合物 : 噁二唑虫 (indoxacarb)、氰氟虫胺 (metaflumizone) ;

[1114] M. 15. 熏蒸剂 : 溴甲烷 (methyl bromide)、氯化苦 (chloropicrin)、磺酰氟 (sulfuryl fluoride) ;

[1115] M. 16. 选择性进食阻断剂 : crylotie、拒嗉酮 (pymetrozine)、氟啶虫酰胺 (flonicamid) ;

[1116] M. 17. 螨生长抑制剂 : 四螨嗪 (clofentezine)、噻螨酮 (hexythiazox)、特苯噁唑 (etoxazole) ;

[1117] M. 18. 几丁质合成抑制剂 : 噻嗪酮 (buprofezin)、双三氟虫脲 (bistrifluron)、定虫隆 (chlorfluazuron)、氟脲杀 (diflubenzuron)、氟螨脲 (flucycloxuron)、氟虫脲 (flufenoxuron)、氟铃脲 (hexaflumuron)、氟丙氧脲 (lufenuron)、双苯氟脲 (novaluron)、多氟虫酰脲 (noviflumuron)、伏虫隆 (teflubenzuron)、杀虫隆 (triflumuron) ;

[1118] M. 19. 类脂生物合成抑制剂：螺螨酯 (spirodiclofen)、螺甲螨酯 (spiromesifen)、螺虫乙酯 (spirotetramat)；

[1119] M. 20. 章鱼胺能激动剂 (Octapaminergic agonsits)：双甲脒 (amitraz)；

[1120] M. 21. 鱼尼汀 (Ryanodine) 受体调节剂：氟虫酰胺 (flubendiamide) 和邻苯二甲酰胺化合物 (R)-、(S)-3-氯-N1-[2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基]-N2-(1-甲基-2-甲基磺酰基乙基)邻苯二甲酰胺 (M21.1)；

[1121] M. 22. 异噁唑啉化合物：4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氢异噁唑-3-基]-2-甲基-N-吡啶-2-基甲基苯甲酰胺 (M22.1)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氢异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2,2,2-三氟乙基)苯甲酰胺 (M22.2)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氢异噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(2,2,2-三氟乙基氨基甲酰基)甲基]苯甲酰胺 (M22.3)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氢异噁唑-3-基]萘-1-甲酸[(2,2,2-三氟乙基氨基甲酰基)甲基]酰胺 (M22.4)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氢异噁唑-3-基]-N-[(甲氧亚氨基)甲基]-2-甲基苯甲酰胺 (M22.5)、4-[5-(3-氯-5-三氟甲基苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氢异噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(2,2,2-三氟乙基氨基甲酰基)甲基]苯甲酰胺 (M22.6)、4-[5-(3-氯-5-三氟甲基苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氢异噁唑-3-基]萘-1-甲酸[(2,2,2-三氟乙基氨基甲酰基)甲基]酰胺 (M22.7) 和 5-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氢异噁唑-3-基]-2-[1,2,4]三唑-1-基苄腈 (M22.8)；

[1122] M. 23. 邻氨基苯甲酰胺 (Anthranilamide) 化合物：氯虫酰胺 (chloranthraniliprole)、氰虫酰胺 (cyantraniliprole)、5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[4-氰基-2-(1-环丙基乙基氨基甲酰基)-6-甲基苯基]酰胺 (M23.1)、5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[2-氯-4-氰基-6-(1-环丙基乙基氨基甲酰基)苯基]酰胺 (M23.2)、5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[2-溴-4-氰基-6-(1-环丙基乙基氨基甲酰基)苯基]酰胺 (M23.3)、5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[2-溴-4-氯-6-(1-环丙基乙基氨基甲酰基)苯基]酰胺 (M23.4)、5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[2,4-二氯-6-(1-环丙基乙基氨基甲酰基)苯基]酰胺 (M23.5)、5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[4-氯-2-(1-环丙基乙基氨基甲酰基)-6-甲基苯基]酰胺 (M23.6)、N'-(2-{[5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-羰基]氨基}-5-氯-3-甲基苯甲酰基)肼甲酸甲酯 (M23.7)、N'-(2-{[5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-羰基]氨基}-5-氯-3-甲基苯甲酰基)-N'-甲基肼甲酸甲酯 (M23.8)、N'-(2-{[5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-羰基]氨基}-5-氯-3-甲基苯甲酰基)-N,N'-二甲基肼甲酸甲酯 (M23.9)、N'-(3,5-二溴-2-{[5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-羰基]氨基}苯甲酰基)肼甲酸甲酯 (M23.10)、N'-(3,5-二溴-2-{[5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-羰基]氨基}苯甲酰基)-N'-甲基肼甲酸甲酯 (M23.11) 和 N'-(3,5-二溴-2-{[5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-羰基]氨基}苯甲酰基)肼甲酸甲酯 (M23.12)；

基)-N, N' -二甲基胍甲酸甲酯 (M23.12) ;

[1123] M.24. 丙二腈化合物:2-(2,2,3,3,4,4,5,5-八氟戊基)-2-(3,3,3-三氟丙基)丙二腈(CF₂HCF₂CF₂CF₂CH₂C(CN)₂CH₂CH₂CF₃) (M24.1) 和 2-(2,2,3,3,4,4,5,5-八氟戊基)-2-(3,3,4,4,4-五氟丁基)丙二腈(CF₂HCF₂CF₂CF₂CH₂C(CN)₂CH₂CH₂CF₂CF₃) (M24.2) ;

[1124] M.25. 微生物干扰剂:苏云金芽孢杆菌以色列亚种(*Bacillus thuringiensis* subsp. *Israelensis*)、球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus*)、苏云金芽孢杆菌鲑泽亚种(*Bacillus thuringiensis* subsp. *Aizawai*)、*Bacillus thuringiensis* subsp. *Kurstaki*、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种菌株(*Bacillus thuringiensis* subsp. *Tenebrionis*) ;

[1125] M.26. 氨基呋喃酮化合物:4-[(6-溴吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.1)、4-[(6-氟吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.2)、4-[(2-氯-1,3-噻唑-5-基)甲基](2-氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.3)、4-[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.4)、4-[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.5)、4-[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](甲基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.6)、4-[(5,6-二氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.7)、4-[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](环丙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.8)、4-[(6-氯吡啶-3-基)甲基](环丙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.9) 和 4-[(6-氯吡啶-3-基)甲基](甲基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.10) ;

[1126] M.27. 其他各种化合物:磷化铝(aluminium phosphide)、磺胺螨酯(amidoflumet)、benclotiaz、苯螨特(benzoximate)、联苯胍酯(bifenazate)、硼砂、溴螨酯(bromopropylate)、氰化物、cyenopyrafen、丁氟螨酯(cyflumetofen)、啞菌酮(chinomethionate)、三氯杀螨醇(dicofol)、氟乙酸酯、磷、啞虫丙醚(pyridalyl)、pyrifluquinazon、硫、有机硫化合物、酒石酸氧锑钾(tartar emetic)、sulfoxafloz, N-R' -2,2-二halo-1-R'' -环丙烷甲酰胺-2-(2,6-二氯- α , α , α -三氟对甲苯基)脞或N-R' -2,2-二(R''')丙酰胺-2-(2,6-二氯- α , α , α -三氟对甲苯基)脞,其中R' 为甲基或乙基,halo为氯或溴,R'' 为氢或甲基且R''' 为甲基或乙基,4-丁-2-炔基氧基-6-(3,5-二甲基吡啶-1-基)-2-氟嘧啶(M27.1)、环丙烷乙酸1,1'-[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-4-[(2-环丙基乙酰基)氧基]甲基]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氢-12-羟基-4,6a,12b-三甲基-11-氧代-9-(3-吡啶基)-2H,11H-萘并[2,1-b]吡喃并[3,4-e]吡喃-3,6-二基]酯(M27.2) 和 8-(2-环丙基甲氧基-4-三氟甲基苯氧基)-3-(6-三氟甲基哒嗪-3-基)-3-氮杂双环[3.2.1]辛烷(M27.3)。

[1127] M组的市售化合物尤其可以在The Pesticide Manual,第13版,British Crop Protection Council(2003)中找到。

[1128] 对氧磷(Paraoxon)及其制备描述于Farm Chemicals Handbook,第88卷,Meister Publishing Company,2001中。吡氟硫磷(Flupyrzofos)描述于Pesticide Science54,1988,第237-243页和US 4822779中。AKD 1022及其制备描述于US 6300348中。M 21.1由WO 2007/101540已知。异噁唑啉M22.1-M22.8例如描述于WO2005/085216,WO 2007/079162,WO 2007/026965,WO 2009/126668和WO2009/051956中。邻氨基苯甲酰

胺 M23.1-M23.6 描述于 WO 2008/72743 和 WO 200872783 中,而那些 M23.7-M23.12 描述于 WO 2007/043677 中。丙二腈类 M24.1 和 M24.2 描述于 WO 02/089579, WO 02/090320, WO 02/090321, WO 04/006677, WO 05/068423, WO 05/068432 和 WO 05/063694 中。M26.1-M26.10 例如描述于 WO 2007/115644 中。M27.1 例如描述于 JP 2006131529 中。有机硫化合物描述于 WO 2007060839 中。M 27.2 描述于 WO 2008/66153 和 WO 2008/108491 中。M 27.3 描述于 JP 2008/115155 中。杀真菌混合配对尤其是选自如下的那些:

[1129] 酰基丙氨酸类,例如苯霜灵 (benalaxyl)、甲霜灵 (metalaxyl)、甲呋酰胺 (ofurace)、噁霜灵 (oxadixyl);

[1130] 胺衍生物,例如 4-十二烷基-2,6-二甲基吗啉 (aldimorph)、多果定 (dodine)、吗菌灵 (dodemorph)、丁苯吗啉 (fenpropimorph)、苯锈啉 (fenpropidin)、双胍盐 (guazatine)、双胍辛醋酸盐 (iminooctadine)、螺噁茂胺 (spiroxamin)、克啉菌 (tridemorph);

[1131] 苯胺基嘧啶类,例如二甲嘧菌胺 (pyrimethanil)、嘧菌胺 (mepanipyrim) 或环丙嘧啶 (cyrodinyl);

[1132] 抗菌素,例如放线菌酮 (cycloheximid)、灰黄霉素 (griseofulvin)、春雷素 (kasugamycin)、多马霉素 (natamycin)、多氧霉素 (polyoxin) 或链霉素 (streptomycin);

[1133] 唑类,例如双苯三唑醇 (bitertanol)、糠菌唑 (bromoconazole)、环唑醇 (cyproconazole)、醚唑 (difenoconazole)、烯唑醇 (diniconazole)、氧唑菌 (epoxiconazole)、腈苯唑 (fenbuconazole)、喹唑菌酮 (fluquinconazole)、氟硅唑 (flusilazole)、己唑醇 (hexaconazole)、烯菌灵 (imazalil)、环戊唑菌 (metconazole)、腈菌唑 (myclobutanil)、戊菌唑 (penconazole)、丙环唑 (propiconazole)、丙氯灵 (prochloraz)、丙硫菌唑 (prothioconazole)、戊唑醇 (tebuconazole)、三唑酮 (triadimefon)、唑菌醇 (triadimenol)、氟菌唑 (triflumizol)、戊叉唑菌 (triticonazole)、粉唑醇 (flutriafol);

[1134] 二羧酰亚胺类,例如异丙定 (iprodion)、甲菌利 (myclozolin)、杀菌利 (procymidon)、烯菌酮 (vinclozolin);

[1135] 二硫代氨基甲酸盐类,例如福美铁 (ferbam)、代森钠 (nabam)、代森锰 (maneb)、代森锰锌 (mancozeb)、威百亩 (metam)、代森联 (metiram)、甲基代森锌 (propineb)、福代锌 (polycarbamate)、福美双 (thiram)、福美锌 (ziram)、代森锌 (zineb);

[1136] 杂环化合物,例如敌菌灵 (anilazine)、苯菌灵 (benomyl)、啉酰菌胺 (boscalid)、多菌灵 (carbendazim)、萎锈灵 (carboxin)、氧化萎锈灵 (oxycarboxin)、氰霜唑 (cyazofamid)、棉隆 (dazomet)、二噻农 (dithianon)、噁唑酮菌 (famoxadon)、咪唑菌酮 (fenamidon)、异噻菌醇 (fenarimol)、麦穗宁 (fuberidazole)、氟酰胺 (flutolanil)、呋吡唑灵 (furametpyr)、稻瘟灵 (isoprothiolane)、丙氧灭锈胺 (mepronil)、氟苯嘧啶醇 (nuarimol)、噻菌灵 (probenazole)、丙氧喹啉 (proquinazid)、啉斑肟 (pyrifenox)、咯喹酮 (pyroquilon)、喹氧灵 (quinoxifen)、硅噻菌胺 (silthiofam)、涕必灵 (thiabendazole)、溴氟唑菌 (thifluzamid)、甲基托布津 (thiophanate-methyl)、噻酰菌胺 (tiadinil)、三环唑 (tricyclazole)、噻氮灵 (triforine);

[1137] 铜杀真菌剂,例如波尔多液(Bordeaux 混合物)、乙酸铜、王铜、碱式硫酸铜;

[1138] 硝基苯基衍生物,例如乐杀螨(binapacryl)、敌螨普(dinocap)、敌螨通(dinobuton)、异丙消(nitrophthal-isopropyl);

[1139] 苯基吡咯类,例如拌种咯(fenpiclonil)或氟噁菌(fludioxonil);

[1140] 硫;

[1141] 其他杀真菌剂,例如噻二唑素(acibenzolar-S-methyl)、苯噻菌胺(benthiavalicarb)、氯环丙酰胺(carpropamid)、百菌清(chlorothalonil)、环氟菌胺(cyflufenamid)、清菌脲(cymoxanil)、哒菌清(diclomezin)、双氯氰菌胺(diclocymet)、乙霉威(diethofencarb)、克瘟散(edifenphos)、噻唑菌胺(ethaboxam)、环酰菌胺(fenhexamid)、薯瘟锡(fentin-acetate)、氰菌胺(fenoxanil)、嘧菌脲(ferimzone)、氟啶胺(fluzinam)、藻菌磷(fosetyl)、乙膦铝(fosetyl-aluminum)、异丙菌胺(iprovalicarb)、六氯苯(hexachlorobenzene)、苯菌酮(metrafenon)、戊菌隆(pencycuron)、百维灵(propamocarb)、四氯苯酞(phthalide)、甲基立枯磷(tolclofos-methyl)、五氯硝基苯(quintozene)、苯酰菌胺(zoxamid);

[1142] 嗜球果伞素类(strobilurins),如腈嘧菌酯(azoxystrobin)、醚菌胺(dimoxystrobin)、烯肟菌酯(enestroburin)、氟嘧菌酯(fluxastrobin)、亚胺菌(kresoxim-methyl)、叉氨苯酰胺(metominostrobin)、肟醚菌胺(orysastrobin)、啉氧菌酯(picoxystrobin)、唑菌胺酯(pyraclostrobin)、pyribencarb 或肟菌酯(trifloxystrobin);

[1143] 次磺酸衍生物,如敌菌丹(captan)、克菌丹(captan)、抑菌灵(dichlofluanid)、灭菌丹(folpet)、对甲抑菌灵(tolylfluanid);

[1144] 肉桂酰胺及类似化合物,如烯酰吗啉(dimethomorph)、氟联苯菌(flumetover)或氟吗啉(flumorph)。

[1145] 无脊椎动物害虫,即节肢动物和线虫,植物、其中植物生长的土壤或水体可以通过本领域已知的任何施用方法与式 I 化合物或包含它们的组合物接触。这里的“接触”包括直接接触(将化合物/组合物直接施用于无脊椎动物害虫或植物上,通常施用于植物的叶、茎或根上)和间接接触(将化合物/组合物施用于无脊椎动物害虫或植物的场所)。

[1146] 此外,无脊椎动物害虫可以通过使目标害虫,其食物供应源、栖息地、繁殖地或其场所与杀虫有效量的式 I 化合物接触而防治。这里的施用可以在场所、生长中的作物或收获的作物被害虫侵染之前或之后进行。

[1147] “场所”通常是指栖息地、繁殖地、栽培植物、植物繁殖材料(如种子)、土壤、区域、材料或其中害虫或寄生虫生长或可能生长的环境。

[1148] 通常而言,“杀虫有效量”是指对生长获得可观察到的效果所需的活性成分的量,所述效果包括坏死、死亡、阻滞、预防和去除效果,破坏效果或减少目标生物体的出现和活动的效果。对于在本发明中使用的各种化合物/组合物,杀虫有效量可以变化。组合物的杀虫有效量也会根据主要条件如所需杀虫效果及持续时间、天气、目标物种、场所、施用方式等而变化。

[1149] 式 I 化合物以及包含所述化合物的组合物可以用于保护木质材料如树木、护栏、枕木等,以及建筑物如房子、附属建筑、工厂,还有建筑材料、家具、皮革、纤维、乙烯基制品、

电线和电缆等以防蚂蚁和 / 或白蚁, 并防止蚂蚁和白蚁损害作物或人类 (例如当害虫侵入房子和公共设施时)。这些化合物不仅施用于周围的土壤表面或地板下的土壤中以保护木质材料, 而且还可以施用于堆积制品如地板下混凝土、亭柱、梁、胶合板、家具等的表面, 木质制品如碎料板、半包板 (half board) 等以及乙烯基制品如包覆的电线、乙烯基片材, 绝热材料如苯乙烯泡沫等。在防止蚂蚁损害作物或人类的施用中, 将本发明的蚂蚁防治剂施用于作物或周围土壤, 或直接施用于蚂蚁的巢穴等。

[1150] 式 I 化合物还可以预防性地施用于预期出现害虫的地方。

[1151] 式 I 化合物还可以通过使生长中的植物与杀虫有效量的式 I 化合物接触而用于保护植物免受害虫侵袭或侵染。这里的“使植物与……接触”包括直接接触 (将化合物 / 组合物直接施用于害虫和 / 或植物上, 通常施用于植物的叶、茎或根上) 和间接接触 (将化合物 / 组合物施用于害虫和 / 或植物的场所)。

[1152] 在土壤处理或施用于害虫居住地或巢穴的情况下, 活性成分量为 0.0001-500g/100m², 优选 0.001-20g/100m²。

[1153] 在材料保护中的常规施用率例如为 0.01-1000g 活性化合物 /m² 被处理材料, 理想的是 0.1-50g/m²。

[1154] 用于材料浸渍中的杀虫组合物通常含有 0.001-95 重量 %, 优选 0.1-45 重量 %, 更优选 1-25 重量 % 至少一种驱避剂和 / 或杀虫剂。

[1155] 为了用于诱饵组合物中, 活性成分的典型含量为 0.001-15 重量 %, 理想的是 0.001-5 重量 % 活性化合物。

[1156] 为了用于喷雾组合物中, 活性成分的含量为 0.001-80 重量 %, 优选 0.01-50 重量 %, 最优选 0.01-15 重量 %。

[1157] 为了用于处理农作物, 本发明活性成分的施用率可以为 0.1-4000g/ha, 理想的是 5-600g/ha, 更理想的是 10-300g/ha。

[1158] 在种子处理中, 活性成分的施用率通常为 0.1g-10kg/100kg 种子, 优选 1g-1kg/100kg 种子, 尤其是 1-250g/100kg 种子, 尤其是 10-150g/100kg 种子。

[1159] 现在由下列实施例更详细说明本发明。

[1160] I. 制备实施例

[1161] 通过适当改变原料, 使用下列合成实施例中所给程序制备其他化合物 I。以此方式得到的化合物与物理数据一起列于下表 B 中。

[1162] 如下所示产物由熔点测定、NMR 光谱法或通过 HPLC-MS 光谱法测定的质量 ([m/z]) 或保留时间 (RT; [min.]) 表征。

[1163] HPLC-MS= 高效液相色谱法 / 质谱法联用; 实施例 1-27 的 HPLC 条件: HPLC 柱: RP-18 柱 (德国 Merck KgaA 的 Chromolith® Speed ROD), 50*4.6mm; 移动相: 乙腈 + 0.1% 三氟乙酸 (TFA) / 水 + 0.1% TFA, 在 40°C 下在 5 分钟内使用 5:95-100:0 的梯度, 流速 1.8ml/min。

[1164] 实施例 28-32 的 HPLC 条件: HPLC 柱: RP-18 柱 (德国 Phenomenex 的 Kinetex™ XB C18 1.7 μ), 50*2.0mm; 移动相: 乙腈 + 0.1% 三氟乙酸 (TFA) / 水 + 0.1% TFA, 在 60°C 下在 1.5 分钟内使用 5:95-100:0 的梯度, 流速为 0.8ml/min 至 1.0ml/min。

[1165] MS: 四极电喷射离子化, 80V (正模式)。

[1166] 制备 5-甲基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1H-吡唑-4-甲酸 [1-甲基-1H-哒嗪-(4E)-亚基] 酰胺 (实施例 7)

[1167] 将 5-甲基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1H-吡唑-4-甲酸哒嗪-4-基酰胺 (500mg, 1.75mmol, 1.0 当量) 和碳酸铯 (1.43g, 2.28mmol, 2.5 当量) 悬浮于 30ml 二甲基甲酰胺 (DMF) 中。加入甲基碘 (324mg, 2.28mmol, 1.3 当量) 并将该混合物在 60℃ 下搅拌过夜。减压除去溶剂, 将残余物用 CH_2Cl_2 稀释并用水洗涤。分离各层, 将有机层在 Na_2SO_4 上干燥、过滤并减压除去溶剂。将残余物用石油醚和甲基叔丁基醚 (MTBE) 的混合物研制, 得到 259mg 标题化合物 (47%, 95% 纯度)。LC-MS: Ret. 1.840min, 300.1 [M+]

[1168] 实施例: 式 I 化合物

[1169]

实 施 例	A	X	R ¹	r.t.[min]	m
1	5-二氟甲基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1H-吡唑-4-基	O	吡啶-2-基甲基	2.285	413.0
2	5-甲基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1H-吡唑-4-基	O	吡啶-2-基甲基	2.026	377.1
3	5-甲基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1H-吡唑-4-基	O	烯丙基	1.992	326.1
4	5-二氟甲基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1H-吡唑-4-基	O	吡啶-3-基甲基	1.851	413.0
5	5-甲基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1H-吡唑-4-基	O	吡啶-3-基甲基	1.600	377.1
6	5-二氟甲基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1H-吡唑-4-基	O	四氢呋喃-2-基甲基	2.313	406.1
7	5-甲基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1H-吡唑-4-基	O	甲基	1.840	300.1

[1170]

实 施 例	A	X	R ¹	r.t.[min]	m
8	1-(2-甲氧基乙基)-5-甲基-1H-吡唑-4-基	O	吡啶-2-基甲基	1.829	353.2
9	1-(2-甲氧基乙基)-5-甲基-1H-吡唑-4-基	O	苄基	2.254	352.1
10	1-(环丙基甲基)-5-甲基-1H-吡唑-4-基	O	吡啶-2-基甲基	2.128	349.1
11	1-(环丙基甲基)-5-甲基-1H-吡唑-4-基	O	苄基	2.504	348.1
12	1-异丙基-5-甲基-1H-吡唑-4-基	O	吡啶-2-基甲基	2.032	337.1
13	1-异丙基-5-甲基-1H-吡唑-4-基	O	苄基	2.431	336.1
14	1-(环丙基甲基)-5-甲基-1H-吡唑-4-基	O	甲基	1.915	272.1
15	1-(环丙基甲基)-5-甲基-1H-吡唑-4-基	O	烯丙基	2.133	298.1
16	1-异丙基-5-甲基-1H-吡唑-4-基	O	甲基	1.756	260.1
17	1-异丙基-5-甲基-1H-吡唑-4-基	O	烯丙基	2.042	286.1
18	4-甲基噻唑-5-基	O	苄基	2.109	311.0
19	4-甲基噻唑-5-基	O	吡啶-2-基甲基	1.687	312.0
20	4-甲基噻唑-5-基	O	烯丙基	1.617	261.1
21	3-甲基异噻唑-4-基	O	苄基	2.162	311.1
22	3-甲基异噻唑-4-基	O	苄基	2.178	295.1
23	2,4-二甲基嘧啶-5-基	O	甲基	1.266	244.0
24	2,4-二甲基嘧啶-5-基	O	苄基	1.994	320.0
25	2,4-二甲基嘧啶-5-基	O	吡啶-2-基甲基	1.617	321.0
27	1-异丙基-5-甲基-1H-吡唑-4-基	O	甲氧基甲基	1.873	290.1
28	5-甲基-1-(2,2,2-三氟-1-甲基乙基)-1H-吡唑-4-基	O	甲氧基甲基	0.759	344.1
29	5-甲基-1-(2,2,2-三氟-1-甲基乙基)-1H-吡唑-4-基	O	苄基	0.905	390.1
30	5-甲基-1-(2,2,2-三氟-1-甲基乙基)-1H-吡唑-4-基	O	吡啶-2-基甲基	0.802	391.1
31	5-甲基-1-(2,2,2-三氟-1-甲基乙基)-1H-吡唑-4-基	O	烯丙基	0.795	340.1
32	5-甲基-1-(2,2,2-三氟-1-甲基乙基)-1H-吡唑-4-基	O	甲基	0.721	314.1

[1171] r. t. =HPLC 保留时间 m=[M]⁺ 峰的分子量

[1172] II. 杀虫活性的评价：

[1173] II.1 棉蚜 (*Aphis gossypii*, 混合生命阶段)

[1174] 在环己酮中将活性化合物配制成在 1.3ml **ABgene**[®]管中供应的 10,000ppm 溶液。将这些管插入装备有雾化喷嘴的自动静电喷雾器中并作为储备溶液使用,在 50% 丙酮:50% 水(体积)中由该储备溶液产生更低稀释度。非离子表面活性剂(**Kinetic**[®])以 0.01%(体积)的量包括在该溶液中。

[1175] 在处理之前通过将来自主蚜虫群体的重度侵染的叶子置于各子叶的顶部而将子叶阶段的棉花植株用蚜虫侵染。使蚜虫经过整夜转移而实现 80-100 只蚜虫/植株的侵染并移走宿主叶子。然后通过装备有雾化喷嘴的自动静电植株喷雾器喷雾侵染的植株。在喷雾器通风橱中干燥各植株,从喷雾器中取出,然后在生长室中在荧光光照下于 25℃和 20-40%的相对湿度维持 24 小时光照期。5 天后相对于未处理对照植物上的死亡率测定被处理植株上的蚜虫死亡率。

[1176] 在该测试中,与未处理对照相比,化合物 2、3、4、5、6、7、8、10、11、12、15、16、17、24 和 25 分别在 300ppm 下显示出至少 75% 的死亡率。

[1177] II.2 绿桃蚜 (*Myzus persicae*, 混合生命阶段)

[1178] 在环己酮中将活性化合物配制成在 1.3ml **ABgene**[®]管中供应的 10,000ppm 溶液。将这些管插入装备有雾化喷嘴的自动静电喷雾器中并作为储备溶液使用,在 50% 丙酮:50% 水(体积)中由该储备溶液产生更低稀释度。非离子表面活性剂(**Kinetic**[®])以 0.01%(体积)的量包括在该溶液中。

[1179] 在处理之前通过将来自主蚜虫群体的重度侵染的叶子置于被处理植株的顶部而将第一真叶阶段的柿子椒植株侵染。使蚜虫经过整夜转移而实现 30-50 只蚜虫/植株的侵染并移走宿主叶子。然后通过装备有雾化喷嘴的自动静电植株喷雾器喷雾侵染的植株。在喷雾器通风橱中干燥各植株,取出,然后在生长室中在荧光光照下于 25℃和 20-40%的相对湿度维持 24 小时光照期。5 天后相对于未处理对照植物上的死亡率测定被处理植株上的蚜虫死亡率。

[1180] 在该测试中,与未处理对照相比,化合物 1、2、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、23、24 和 25 分别在 300ppm 下显示出至少 75% 的死亡率。

[1181] II.3 豇豆蚜 (豆蚜 (*Aphis craccivora*))

[1182] 将活性化合物在 50:50(体积比)丙酮/水中配制。测试溶液在使用当天制备。

[1183] 在记录害虫种群之后喷雾被 100-150 只各个阶段的蚜虫定居的盆栽豇豆植株。24、72 和 120 小时之后评价种群减少。

[1184] 在该测试中,与未处理对照相比,化合物 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、16、17、21、23、24 和 25 分别在 300ppm 下显示出至少 90% 的死亡率。

[1185] II.4 蚕豆修尾蚜 (*Megoura viciae*)

[1186] 将活性化合物在 1:3(体积)DMSO:水中以不同浓度的配制化合物配制。

[1187] 将豆叶片放入填充有 0.8% 琼脂和 2.5ppm OPUS[™]的微量滴定板中。用 2.5 μL 测试溶液喷雾叶片并将 5-8 只蚜虫成虫放入微量滴定板中,然后封闭微量滴定板并在荧光下于 23±1℃和 50±5%相对湿度下保持 6 天。基于活的繁殖蚜虫评价死亡率。然后肉眼评价

蚜虫死亡率和繁殖力。

[1188] 在该试验中,化合物 1、3、4、6、7、8、9、10、11、12、13、15、17 和 27 分别在 2500mg/l 的测试溶液浓度下显示出至少 90% 的死亡率。

[1189] II.5 棉铃象甲 (墨西哥棉铃象)

[1190] 化合物在 75:25 (体积) 水 :DMSO 中配制。

[1191] 为了评价对棉铃象甲 (墨西哥棉铃象) 的防治,测试单元由含有昆虫膳食和 20-30 只墨西哥棉铃象卵的 24 孔微滴定板构成。使用定制微雾化器将不同浓度的配制化合物喷雾于昆虫膳食上,重复两次。在施用之后,将微滴定板在约 $23 \pm 1^\circ\text{C}$ 和约 $50 \pm 5\%$ 相对湿度下温育 5 天。然后肉眼评价卵和幼虫死亡率。

[1192] 在该测试中,化合物 2、4、6、8、12、13 和 22 分别在 2500mg/L 的测试溶液浓度下显示出至少 50% 的死亡率。

[1193] II.6 对绿桃蚜 (*Myzus persicae*) 的活性

[1194] 为了通过内吸方式评价对绿桃蚜 (*Myzus persicae*) 的防治,测试单元由在人造膜下含有液体人工膳食的 96 孔微滴定板构成。

[1195] 使用含有 75 体积 % 水和 25 体积 %DMSO 的溶液配制化合物。使用定制微雾化器将不同浓度的配制化合物吸移于蚜虫膳食上,重复两次。在施用之后,将 5-8 只成虫蚜虫置于微滴定板孔内的人工膜上。然后使蚜虫在被处理蚜虫膳食上吮吸并在约 $23 \pm 1^\circ\text{C}$ 和约 $50 \pm 5\%$ 相对湿度下温育 3 天。然后肉眼评价蚜虫死亡率和繁殖力。

[1196] 在该测试中,与未处理对照相比,化合物 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、23、24、25 和 27 分别在 2500ppm 下显示出 100% 的死亡率。

[1197] II.7 银叶粉虱 (*Bemisia argentifolii*, 成虫)

[1198] 在环己酮中将活性化合物配制成在 1.3ml **ABgene**[®] 管中供应的 10,000ppm 溶液。将这些管插入装备有雾化喷嘴的自动静电喷雾器中并作为储备溶液使用,在 50% 丙酮 :50% 水 (体积) 中由该储备溶液产生更低稀释度。非离子表面活性剂 (**Kinetic**[®]) 以 0.01% (体积) 的量包括在该溶液中。

[1199] 通过装备有雾化喷嘴的自动静电植株喷雾器喷雾子叶阶段的棉花植株 (每盆一株)。在喷雾器通风橱中干燥各植株,然后由喷雾器中取出。将各盆放入塑料杯中并引入 10-12 只银叶粉虱成虫 (约 3-5 天龄)。使用抽吸装置和连接于防护移液管头的 0.6cm 无毒 **Tygon**[®] 管 (R-3603) 收集昆虫。然后将含有收集的昆虫的该管头轻轻地插入含有处理植株的土壤中,使昆虫爬出该管头而到达叶面上取食。将杯子用可反复使用的筛盖 (150 微米网目的聚酯筛 PeCap, 购自 Tetko Inc) 覆盖。将测试植株在生长室中于 25°C 和 20-40% 相对湿度下保持 3 天,并避免直接暴露于荧光 (24 小时光照期) 以防止在杯内截热。在处理 3 天后评价与未处理对照植株相比较的死亡率。

[1200] 在该测试中,与未处理对照相比,化合物 2、3、4、6、7、8、9、10、12、15 和 17 分别在 300ppm 下显示出至少 75% 的死亡率。