



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 105473564 A

(43) 申请公布日 2016. 04. 06

(21) 申请号 201480043335. X

(22) 申请日 2014. 06. 23

(30) 优先权数据

61/838, 354 2013. 06. 24 US

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2016. 02. 01

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/EP2014/063101 2014. 06. 23

(87) PCT国际申请的公布数据

W02014/206907 EN 2014. 12. 31

(71) 申请人 梅里亚股份有限公司

地址 美国佐治亚

(72) 发明人 P·宾德谢德勒 W·冯迪恩

K·克贝尔 D·L·卡伯特森

K·贡伊玛 F·J·布朗

(74) 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专
利商标事务所 11038

代理人 徐达

(51) Int. Cl.

C07D 275/02(2006. 01)

A01N 43/80(2006. 01)

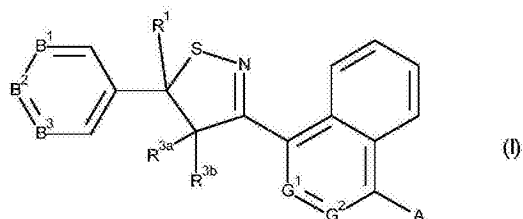
权利要求书13页 说明书119页

(54) 发明名称

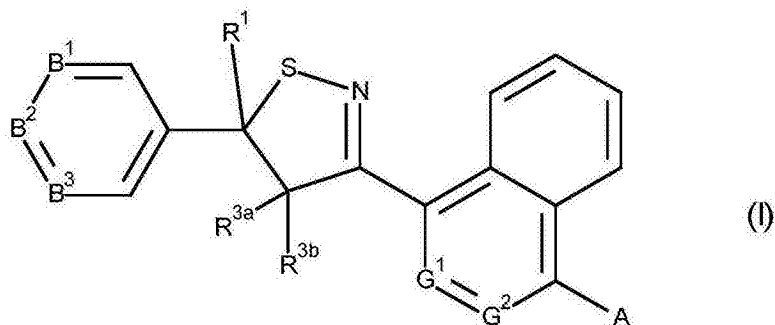
萘基 - 或异喹啉基 - 取代的异噻唑啉化合物

(57) 摘要

本发明涉及式 I 的萘基 - 或异喹啉基 - 取代的异噻唑啉化合物, 其中各变量如权利要求和说明书中所定义。所述化合物用于抗击或防治无脊椎动物病虫害, 尤其是节肢动物病虫害和线虫。本发明也涉及通过使用这些化合物来防治无脊椎动物病虫害的方法和涉及植物繁殖材料和涉及包含所述化合物的农业和兽医学组合物。



1. 式I异噻唑啉化合物



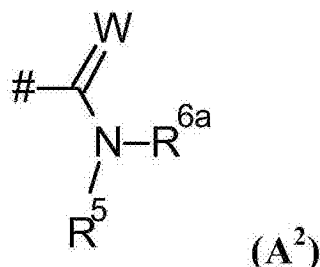
其中

A是基团A¹, A²或A³;

其中

A¹选自-C(=NR⁶)R⁸, -S(O)ₙR⁹, -CN和-N(R⁵)R⁶;

A²是下式的基团:

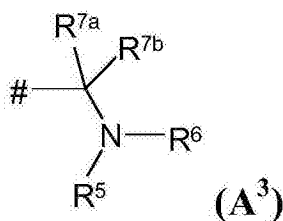


其中

#表示连至分子其余部分的键;

W选自O和S;

A³是下式的基团:



其中

#表示连至式(I)芳族环的键;

B¹, B²和B³各自独立地选自N和CR², 条件是B¹, B²和B³中至多两个是N;

G¹和G²各自独立地选自N和CR⁴, 条件是G¹和G²中至多一个是N;

R¹选自C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷氧基-C₁-C₄-烷基-, C₂-C₄-烯基, C₂-C₄-卤代烯基, C₂-C₄-炔基, C₂-C₄-卤代炔基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基和-C(=O)OR¹⁵;

各R²独立选自氢, 卤素, 氰基, 叠氮基, 硝基, -SCN, -SF₅, C₁-C₆-烷基, C₃-C₈-环烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-炔基, 其中所提及的后4种脂族和环脂族残基可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个残基R⁸取代,

$-\text{Si}(\text{R}^{12})_3, -\text{OR}^9, -\text{S}(\text{O})_n\text{R}^9$, 和 $-\text{NR}^{10a}\text{R}^{10b}$;

$\text{R}^{3a}, \text{R}^{3b}$ 各自独立选自氢, 卤素, 羟基, $-\text{CO}_2\text{R}^{3d}$, $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基, $\text{C}_1\text{-C}_3$ -卤代烷基, $\text{C}_2\text{-C}_3$ -烯基, $\text{C}_2\text{-C}_3$ -炔基, $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷氧基, $\text{C}_1\text{-C}_3$ -卤代烷氧基, $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷硫基, $\text{C}_1\text{-C}_3$ -卤代烷硫基, $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基磺酰基和 $\text{C}_1\text{-C}_3$ -卤代烷基磺酰基; 或

R^{3a} 和 R^{3b} 一起形成基团 $=\text{O}, =\text{C}(\text{R}^{3c})_2, =\text{NOH}$ 或 $=\text{NOCH}_3$;

各 R^{3c} 独立选自氢, 卤素, CH_3 和 CF_3 ;

R^{3d} 选自氢, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基和 $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基-;

各 R^4 独立选自氢, 卤素, 氰基, 叠氮基, 硝基, $-\text{SCN}$, $-\text{SF}_5$, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基, 其可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个残基 R^8 取代, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基, 其可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个残基 R^8 取代, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -烯基, 其可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个残基 R^8 取代, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -炔基, 其可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个残基 R^8 取代, $-\text{Si}(\text{R}^{12})_3, -\text{OR}^9, -\text{S}(\text{O})_n\text{R}^9$, 和 $-\text{NR}^{10a}\text{R}^{10b}$;

各 R^5 独立选自氢, $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -烷基, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基, $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -烯基, $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -炔基, 其中所提及的后4种脂族和环脂族残基可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个取代基 R^8 取代,

R^{6a} 选自 $-\text{X}-\text{R}^{6b}$ 和 $-\text{N}(\text{R}^{5a})\text{R}^{6c}$; 其中

X 选自 $-\text{C}(\text{R}^a)_2-, -\text{C}(\text{R}^a)_2-\text{C}(\text{R}^a)_2-, -\text{C}(\text{R}^a)_2-\text{C}(=\text{O})-\text{NR}^{10a}-\text{C}(\text{R}^a)_2-, -\text{C}(\text{R}^a)_2-\text{C}(\text{R}^a)_2-\text{C}(=\text{O})-\text{NR}^{10a}-\text{C}(\text{R}^a)_2-, -\text{C}(\text{R}^a)_2\text{S}(\text{O})_n-\text{C}(\text{R}^a)_2-, -\text{C}(\text{R}^a)_2-\text{C}(\text{R}^a)_2-\text{S}(\text{O})_n-\text{C}(\text{R}^a)_2-, -\text{C}(\text{R}^a)_2-\text{O}-\text{C}(\text{R}^a)_2-,$ 和 $-\text{C}(\text{R}^a)_2-\text{C}(\text{R}^a)_2-\text{O}-\text{C}(\text{R}^a)_2-$, 其中

各 R^a 独立选自氢, 卤素, $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基, 和 $\text{C}_1\text{-C}_3$ -卤代烷基;

R^{5a} 独立具有对 R^5 给定的含义之一;

R^{6b} 选自 $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基, $\text{C}_2\text{-C}_8$ -烯基, $\text{C}_2\text{-C}_8$ -炔基, 其中所提及的后3种残基可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个取代基 R^8 取代; 和

R^{6c} 选自氢, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -卤代环烷基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -烯基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -卤代烯基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -炔基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -卤代炔基, 其中所提及的后8种残基中的脂族和环脂族部分可以被一个或多个残基 R^{13} 取代; $-\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基- $\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{15}$, $-\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基- $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{14a})\text{R}^{14b}$, $-\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基- $\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{14a})\text{R}^{14b}$, $-\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基- $\text{C}(=\text{NR}^{14})\text{N}(\text{R}^{14a})\text{R}^{14b}$, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷氧基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷氧基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷硫基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷硫基,

$-\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{15}$, $-\text{S}(\text{O})_n\text{N}(\text{R}^{14a})\text{R}^{14b}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{13}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{15}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{14a})\text{R}^{14b}$, $-\text{C}(=\text{S})\text{R}^{13}$, $-\text{C}(=\text{S})\text{SR}^{15}$, $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{14a})\text{R}^{14b}$, 和 $-\text{C}(=\text{NR}^{14})\text{R}^{13}$;

其中在 R^5 是氢的情况下, R^{6a} 还选自氢, 1-氰基环丙基, 1-氰基环丁基和1-氰基戊基; 或

R^5 和 R^{6a} 一起形成基团 $=\text{S}(\text{O})_m(\text{R}^9)_2$;

各 R^6 独立选自氢, 氰基, $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -烷基, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基, $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -烯基, $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -炔基, 其中所提及的后4种脂族和环脂族残基可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个取代基 R^8 取代, $-\text{OR}^9, -\text{NR}^{10a}\text{R}^{10b}, -\text{S}(\text{O})_n\text{R}^9, -\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{10a}\text{N}(\text{R}^{10a}\text{R}^{10b}), -\text{Si}(\text{R}^{12})_3, -\text{C}(=\text{O})\text{R}^8$,

苯基, 其可以被1、2、3、4或5个取代基 R^{11} 取代, 和3-、4-、5-、6-、7-、8-、9-或10-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂单环或杂双环, 其含有1、2、3或4个独立选自N、O、S、NO、SO和 SO_2 的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中该杂单环或杂双环可以被一个或多个取代基 R^{11} 取代;

或 R^5 和 R^6 或 R^5 和 R^{6a} 与它们结合至的氮原子一起形成3-、4-、5-、6-、7-或8-元饱和、部分

不饱和或最大不饱和的杂环,其中所述环可以还含有1、2、3或4个选自O、S、N、SO、SO₂、C=O和C=S的杂原子或含杂原子基团作为环成员,其中所述杂环可以用1、2、3、4或5个取代基取代,所述取代基独立选自卤素,氰基,C₁-C₆-烷基,C₁-C₆-卤代烷基,C₁-C₆-烷氧基,C₁-C₆-卤代烷氧基,C₁-C₆-烷硫基,C₁-C₆-卤代烷硫基,C₃-C₈-环烷基,C₃-C₈-卤代环烷基,C₂-C₆-烯基,C₂-C₆-卤代烯基,C₂-C₆-炔基,C₂-C₆-卤代炔基,其中所提及的后12种残基中的脂族或环脂族部分可以被一个或多个残基R⁸取代,和苯基,其可以被1、2、3、4或5个取代基R¹¹取代;

R^{7a},R^{7b}各自独立选自氢,卤素,氰基,C₁-C₆-烷基,C₃-C₈-环烷基,C₂-C₆-烯基和C₂-C₆-炔基,其中所提及的后4种脂族和环脂族残基可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个残基R⁸取代;

各R⁸独立选自氰基,叠氮基,硝基,-SCN,-SF₅,C₃-C₈-环烷基,C₃-C₈-卤代环烷基,C₃-C₈-环烯基,C₃-C₈-卤代环烯基,其中所提及的后4种残基中的环脂族部分可以被一个或多个残基R¹³取代;

-Si(R¹²)₃,-OR⁹,-OSO₂R⁹,-S(O)_nR⁹,-N(R^{10a})R^{10b},-C(=O)N(R^{10a})R^{10b},-C(=S)N(R^{10a})R^{10b},-C(=O)OR⁹,苯基,任选用1、2、3、4或5个取代基R¹⁶取代,和

3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环,其包含1、2或3个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员,其中所述杂环任选被一个或多个取代基R¹⁶取代,

或

烷基、烯基、炔基或环烷基的相同碳原子上存在的两个R⁸一起形成基团=O,=C(R¹³)₂;=S;=S(O)_m(R¹⁵)₂,=S(O)_mR¹⁵N(R^{14a})R^{14b},=NR^{10a},=NOR⁹;或=NN(R^{10a})R^{10b};

或

两个残基R⁸与它们键合至的烷基、烯基、炔基或环烷基的碳原子一起形成3-、4-、5-、6-、7-或8-元饱和的或部分不饱和的碳环或杂环,其中所述杂环包含1、2、3或4个独立选自N、O、S、NO、SO和SO₂杂原子或杂原子基团作为环成员,和其中所述碳环或杂环任选被一个或多个取代基R¹⁶取代;和

R⁸作为环烷基环上的取代基额外选自C₁-C₆-烷基,C₁-C₆-卤代烷基,C₂-C₆-烯基,C₂-C₆-卤代烯基,C₂-C₆-炔基和C₂-C₆-卤代炔基,其中这6种残基中的脂族部分可以被一个或多个残基R¹³取代;和

基团-C(=NR⁶)R⁸和-C(=O)R⁸中的R⁸额外选自氢,卤素,C₁-C₆-烷基,C₁-C₆-卤代烷基,C₂-C₆-烯基,C₂-C₆-卤代烯基,C₂-C₆-炔基和C₂-C₆-卤代炔基,其中所提及的后6种残基中的脂族部分可以被一个或多个残基R¹³取代;

各R⁹独立选自氢,氰基,C₁-C₆-烷基,C₁-C₆-卤代烷基,C₃-C₈-环烷基,C₃-C₈-环烷基-C₁-C₄-烷基-,C₃-C₈-卤代环烷基,C₂-C₆-烯基,C₂-C₆-卤代烯基,C₂-C₆-炔基,C₂-C₆-卤代炔基,其中所提及的后9种残基中的脂族和环脂族部分可以被一个或多个残基R¹³取代,

-C₁-C₆-烷基-C(=O)OR¹⁵,-C₁-C₆-烷基-C(=O)N(R^{14a})R^{14b},-C₁-C₆-烷基-C(=S)N(R^{14a})R^{14b},-C₁-C₆-烷基-C(=NR¹⁴)N(R^{14a})R^{14b},-Si(R¹²)₃,-S(O)_nR¹⁵,-S(O)_nN(R^{14a})R^{14b},-N(R^{10a})R^{10b},-N=C(R¹³)₂,-C(=O)R¹³,-C(=O)N(R^{14a})R^{14b},-C(=S)N(R^{14a})R^{14b},-C(=O)OR¹⁵,

苯基,任选被一个或多个取代基R¹⁶取代;和

3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环,其包含1、2或3个选自N、O、

S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员,其中所述杂环任选被一个或多个取代基R¹⁶取代;和

基团-S(O)_nR⁹和-OSO₂R⁹中的R⁹额外选自C₁-C₆-烷氧基和C₁-C₆-卤代烷氧基;

R^{10a}, R^{10b}相互独立且各次出现独立地选自氢, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₃-C₈-环烷基, C₃-C₈-卤代环烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-卤代烯基, C₂-C₆-炔基, C₂-C₆-卤代炔基, 其中所提及的后8种残基中的脂族和环脂族部分可以被一个或多个残基R¹³取代; -C₁-C₆-烷基-C(=O)OR¹⁵, -C₁-C₆-烷基-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}, -C₁-C₆-烷基-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}, -C₁-C₆-烷基-C(=NR¹⁴)N(R^{14a})R^{14b}, C₁-C₆-烷氧基, C₁-C₆-卤代烷氧基, C₁-C₆-烷硫基, C₁-C₆-卤代烷硫基,

-S(O)_nR¹⁵, -S(O)_nN(R^{14a})R^{14b}, -C(=O)R¹³, -C(=O)OR¹⁵, -C(=O)N(R^{14a})R^{14b}, -C(=S)R¹³, -C(=S)SR¹⁵, -C(=S)N(R^{14a})R^{14b}, -C(=NR¹⁴)R¹³;

苯基, 任选被1、2、3或4个取代基R¹⁶取代; 和

3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环, 其包含1、2、3或4个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环任选被一个或多个取代基R¹⁶取代;

或

R^{10a}和R^{10b}与它们键合至的氮原子一起形成3-、4-、5-、6-、7-或8-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环, 其中所述杂环可以额外含有一个或两个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环任选携带一个或多个取代基, 所述取代基选自卤素, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₁-C₆-烷氧基, C₁-C₆-卤代烷氧基, C₁-C₆-烷硫基, C₁-C₆-卤代烷硫基, C₃-C₈-环烷基, C₃-C₈-卤代环烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-卤代烯基, C₂-C₆-炔基, C₂-C₆-卤代炔基, 苯基, 任选被1、2、3、4或5个取代基R¹⁶取代, 和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环, 其包含1、2或3个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环任选携带一个或多个取代基R¹⁶;

或R^{10a}和R^{10b}一起形成基团=C(R¹³)₂, =S(O)_m(R¹⁵)₂, =S(O)_mR¹⁵N(R^{14a})R^{14b}, =NR¹⁴或=NOR¹⁵;

R¹¹独立选自卤素, 氰基, 叠氮基, 硝基, -SCN, -SF₅, C₁-C₁₀-烷基, C₃-C₈-环烷基, C₂-C₁₀-烯基, C₂-C₁₀-炔基, 其中所提及的后4种脂族和环脂族残基可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个残基R⁸取代,

-OR⁹, -NR^{10a}R^{10b}, -S(O)_nR⁹, -Si(R¹²)₃;

苯基, 任选被1、2、3、4或5个独立选自R¹⁶的取代基取代;

和

3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的芳族杂环, 其包含1、2、3或4个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环任选被一个或多个独立选自R¹⁶的取代基取代;

或不饱和或部分不饱和杂环的相同环碳原子上存在的两个R¹¹可以一起形成基团=O, =C(R¹³)₂; =S; =S(O)_m(R¹⁵)₂; =S(O)_mR¹⁵N(R^{14a})R^{14b}, =NR¹⁴, =NOR¹⁵, 或=NN(R^{14a})R^{14b}; 或结合在相邻环原子上的两个R¹¹与它们结合至的环原子一起形成饱和的3-、4-、5-、6-、7-、8-或9-元环, 其中所述环可以含有1或2个选自O、S、N、NR¹⁴、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团和/或1或2个选自C=O、C=S和C=NR¹⁴的基团作为环成员, 和其中所述环可以被一个或多个

残基取代,所述残基选自卤素,C₁-C₆-烷基,C₁-C₆-卤代烷基,C₁-C₆-烷氧基,C₁-C₆-卤代烷氧基,C₁-C₆-烷硫基,C₁-C₆-卤代烷硫基,C₃-C₈-环烷基,C₃-C₈-卤代环烷基,C₂-C₆-烯基,C₂-C₆-卤代烯基,C₂-C₆-炔基,C₂-C₆-卤代炔基,苯基,其可以被1、2、3、4或5个残基R¹⁶取代,和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环,其含有1、2或3个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员,其中所述杂环可以被一个或多个残基R¹⁶取代;

各R¹²独立选自氢,卤素,C₁-C₆-烷基,C₁-C₆-卤代烷基,C₁-C₆-烷氧基,C₁-C₆-卤代烷氧基,C₂-C₆-烯基,C₂-C₆-卤代烯基,C₂-C₆-炔基,C₂-C₆-卤代炔基,C₃-C₈-环烷基,C₃-C₈-卤代环烷基,C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基,C₁-C₆-卤代烷氧基-C₁-C₆-烷基,和苯基,任选被1、2、3、4或5个取代基R¹⁶取代;

各R¹³独立选自氰基,硝基,-OH,-SH,-SCN,-SF₅,C₁-C₆-烷氧基,C₁-C₆-卤代烷氧基,C₁-C₆-烷硫基,C₁-C₆-卤代烷硫基,C₁-C₆-烷基亚磺酰基,C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基,C₁-C₆-烷基磺酰基,C₁-C₆-卤代烷基磺酰基,-NR^{14a}R^{14b},-C(=O)NR^{14a}R^{14b},三甲基甲硅烷基,三乙基甲硅烷基,叔丁基二甲基甲硅烷基,

C₃-C₈-环烷基,其可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基,所述残基选自氰基,C₁-C₄-烷基,C₃-C₄-环烷基,C₁-C₄-烷氧基,C₁-C₄-卤代烷氧基和氧代;苯基,苄基,苯氧基,其中所提及的后3种残基中的苯基部分可以是未经取代的或携带1、2、3、4或5个取代基R¹⁶;和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环,其含有1、2或3个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员,其中所述杂环可以被1、2或3个取代基R¹⁶取代;

或

烷基、烯基、炔基或环烷基的相同碳原子上存在的两个R¹³可以一起是=O,=CH(C₁-C₄-烷基),=C(C₁-C₄-烷基)C₁-C₄-烷基,=NR¹⁷或=NOR¹⁷;

和

R¹³作为环烷基环上的取代基额外选自C₁-C₆-烷基,C₂-C₆-烯基和C₂-C₆-炔基,其中所提及的后3种脂族残基可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个取代基,所述取代基选自CN,C₃-C₄-环烷基,C₁-C₄-烷氧基,C₁-C₄-卤代烷氧基和氧代;

和

基团=C(R¹³)₂,-N=C(R¹³)₂,-C(=O)R¹³,-C(=S)R¹³和-C(=NR¹⁴)R¹³中的R¹³额外选自氢,卤素,C₁-C₆-烷基,C₂-C₆-烯基和C₂-C₆-炔基,其中所提及的后3种脂族残基可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基,所述残基选自CN,C₃-C₄-环烷基,C₁-C₄-烷氧基,C₁-C₄-卤代烷氧基和氧代;

各R¹⁴独立选自氢,氰基,C₁-C₆-烷氧基,C₁-C₆-卤代烷氧基,C₁-C₆-烷硫基,C₁-C₆-卤代烷硫基,C₁-C₆-烷基亚磺酰基,C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基,C₁-C₆-烷基磺酰基,C₁-C₆-卤代烷基磺酰基,-C(=O)NR^{18a}R^{18b},三甲基甲硅烷基,三乙基甲硅烷基,叔丁基二甲基甲硅烷基,

C₁-C₆-烷基,C₂-C₆-烯基,C₂-C₆-炔基,其中所提及的后3种脂族残基可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基,所述残基选自CN,C₁-C₄-烷氧基,C₁-C₄-卤代烷氧基,C₁-C₄-烷硫基,C₁-C₄-烷基亚磺酰基,C₁-C₄-烷基磺酰基,C₃-C₄-环烷基,其可以被1或2个取代基取代,所述取代基选自卤素和氰基;和氧代;

C₃-C₈-环烷基,其可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基,所

述残基选自氰基, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-烷氧基, C₁-C₄-卤代烷氧基, C₁-C₄-烷硫基, C₁-C₄-烷基亚磺酰基, C₁-C₄-烷基磺酰基, C₃-C₄-环烷基, C₃-C₄-环烷基-C₁-C₄-烷基-, 其中所提及的后2种残基中的环烷基部分可以被1或2个取代基取代, 所述取代基选自卤素和氰基; 和氧代;

苯基, 苄基, 吡啶基, 苯氧基, 其中所提及的后4种残基中的环状部分可以是未经取代的和/或携带1、2或3个取代基, 所述取代基选自卤素, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₁-C₆-烷氧基, C₁-C₆-卤代烷氧基和(C₁-C₆-烷氧基)羰基; 和3-、4-、5-或6-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环, 其包含1或2个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环任选被一个或多个取代基R¹⁶取代;

R^{14a}和R^{14b}相互独立具有对R¹⁴给定的含义之一; 或

R^{14a}和R^{14b}与它们结合至的氮原子一起形成3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环, 其中所述杂环可以额外含有1或2个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环任选携带一个或多个取代基, 所述取代基选自卤素, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷氧基;

或

R^{14a}和R¹⁴或R^{14b}和R¹⁴与它们在基团-C(=NR¹⁴)N(R^{14a})R^{14b}中结合至的氮原子一起形成3-、4-、5-、6-或7-元部分不饱和的或最大不饱和的杂环, 其中所述杂环可以额外含有1或2个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环任选携带一个或多个取代基, 所述取代基选自卤素, C₁-C₄-卤代烷基, C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷氧基;

各R¹⁵独立选自氢, 氰基, 三甲基甲硅烷基, 三乙基甲硅烷基, 叔丁基二甲基甲硅烷基,

C₁-C₆-烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-炔基, 其中所提及的后3种脂族残基可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基, 所述残基选自C₃-C₄-环烷基, C₁-C₄-烷氧基, C₁-C₄-卤代烷氧基, C₁-C₄-烷硫基, C₁-C₄-烷基亚磺酰基, C₁-C₄-烷基磺酰基和氧代;

C₃-C₈-环烷基, 其可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基, 所述残基选自C₁-C₄-烷基, C₃-C₄-环烷基, C₁-C₄-烷氧基, C₁-C₄-卤代烷氧基, C₁-C₄-烷硫基, C₁-C₄-烷基亚磺酰基, C₁-C₄-烷基磺酰基和氧代;

苯基, 苄基, 吡啶基和苯氧基, 其中所提及的后4种残基可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或携带1、2或3个取代基, 所述取代基选自C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₁-C₆-烷氧基, C₁-C₆-卤代烷氧基和(C₁-C₆-烷氧基)羰基;

各R¹⁶独立选自卤素, 硝基, 氰基, -OH, -SH, C₁-C₆-烷氧基, C₁-C₆-卤代烷氧基, C₁-C₆-烷硫基, C₁-C₆-卤代烷硫基, C₁-C₆-烷基亚磺酰基, C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基, C₁-C₆-烷基磺酰基, C₁-C₆-卤代烷基磺酰基, 三甲基甲硅烷基, 三乙基甲硅烷基, 叔丁基二甲基甲硅烷基;

C₁-C₆-烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-炔基, 其中所提及的后3种脂族残基可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基, 所述残基选自C₃-C₄-环烷基, C₁-C₄-烷氧基, C₁-C₄-卤代烷氧基和氧代;

C₃-C₈-环烷基, 其可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基, 所述残基选自C₁-C₄-烷基, C₃-C₄-环烷基, C₁-C₄-烷氧基, C₁-C₄-卤代烷氧基和氧代;

苯基, 苄基, 吡啶基和苯氧基, 其中所提及的后4种残基可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或携带1、2或3个取代基, 所述取代基选自C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₁-C₆-烷氧基, C₁-C₆-卤代烷氧基和(C₁-C₆-烷氧基)羰基;

或

在不饱和或部分不饱和环的相同原子上一起存在的两个 R^{16} 可以是 $=O$, $=S$, $=N(C_1-C_6-$ 烷基), $=NO(C_1-C_6-$ 烷基), $=CH(C_1-C_4-$ 烷基)或 $=C(C_1-C_4-$ 烷基) C_1-C_4- 烷基;

或

在两个相邻碳原子上的两个 R^{16} 与它们键合至的碳原子一起形成4-、5-、6-、7-或8-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的环,其中所述环可以含有1或2个选自N、O、S、NO、SO和 SO_2 的杂原子或杂原子基团作为环成员,和其中所述环任选携带一个或多个取代基,所述取代基选自卤素, 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,尤其是选自卤素, 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;

R^{17} , R^{18a} 和 R^{18b} 相互独立且各次出现独立地选自氢, C_1-C_6- 烷基, C_2-C_6- 烯基, C_2-C_6- 炔基,其中所提及的后3种脂族残基可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基,所述残基选自CN, C_1-C_4- 烷氧基, C_1-C_4- 卤代烷氧基, C_1-C_4- 烷硫基, C_1-C_4- 烷基亚磺酰基, C_1-C_4- 烷基磺酰基, C_3-C_4- 环烷基,其可以被1或2个取代基取代,所述取代基选自卤素和氰基;和氧代;

C_3-C_8- 环烷基,其可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基,所述残基选自氰基, C_1-C_4- 烷基和 C_1-C_4- 卤代烷基;

苯基和苄基;

各n独立地是0、1或2;和

各m独立地是0或1;

及其N-氧化物、立体异构体和农业上或兽医学上可接受的盐。

2. 权利要求1所要求保护的化合物,其中A是 A^1 和 A^1 是 $-CN$ 。

3. 权利要求1所要求保护的化合物,其中A是 A^1 和 A^1 选自

$-C(=NR^6)R^8$,其中 R^8 是氢和 R^6 是 $-NR^{10a}R^{10b}$,其中

R^{10a} 选自氢, C_1-C_6- 烷基和 C_1-C_6- 卤代烷基;和

R^{10b} 选自 C_1-C_6- 烷基, C_1-C_6- 卤代烷基, C_1-C_6- 烷基羰基, C_1-C_6- 卤代烷基羰基, $-C(=O)OR^{15}$, $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$, $-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$, 苯基,其任选被1、2、3或4个取代基 R^{16} 取代,和5-或6-元杂芳族环,其包含1、2或3个选自N、O和S的杂原子作为环成员,其中所述杂芳族环任选被一个或多个取代基 R^{16} 取代;

其中 R^{14a} , R^{14b} , R^{15} 和 R^{16} 如权利要求1中所定义。

4. 权利要求3所要求保护的化合物,其中

R^{10a} 选自氢和 C_1-C_6- 烷基;和

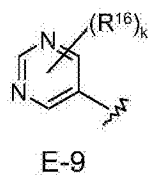
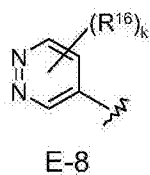
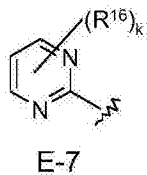
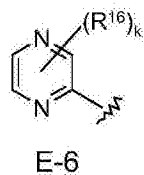
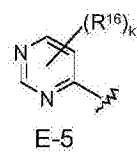
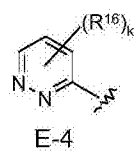
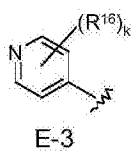
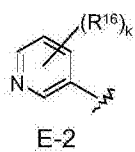
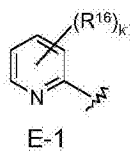
R^{10b} 选自 $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$ 和 $-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$;和尤其是 $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$;

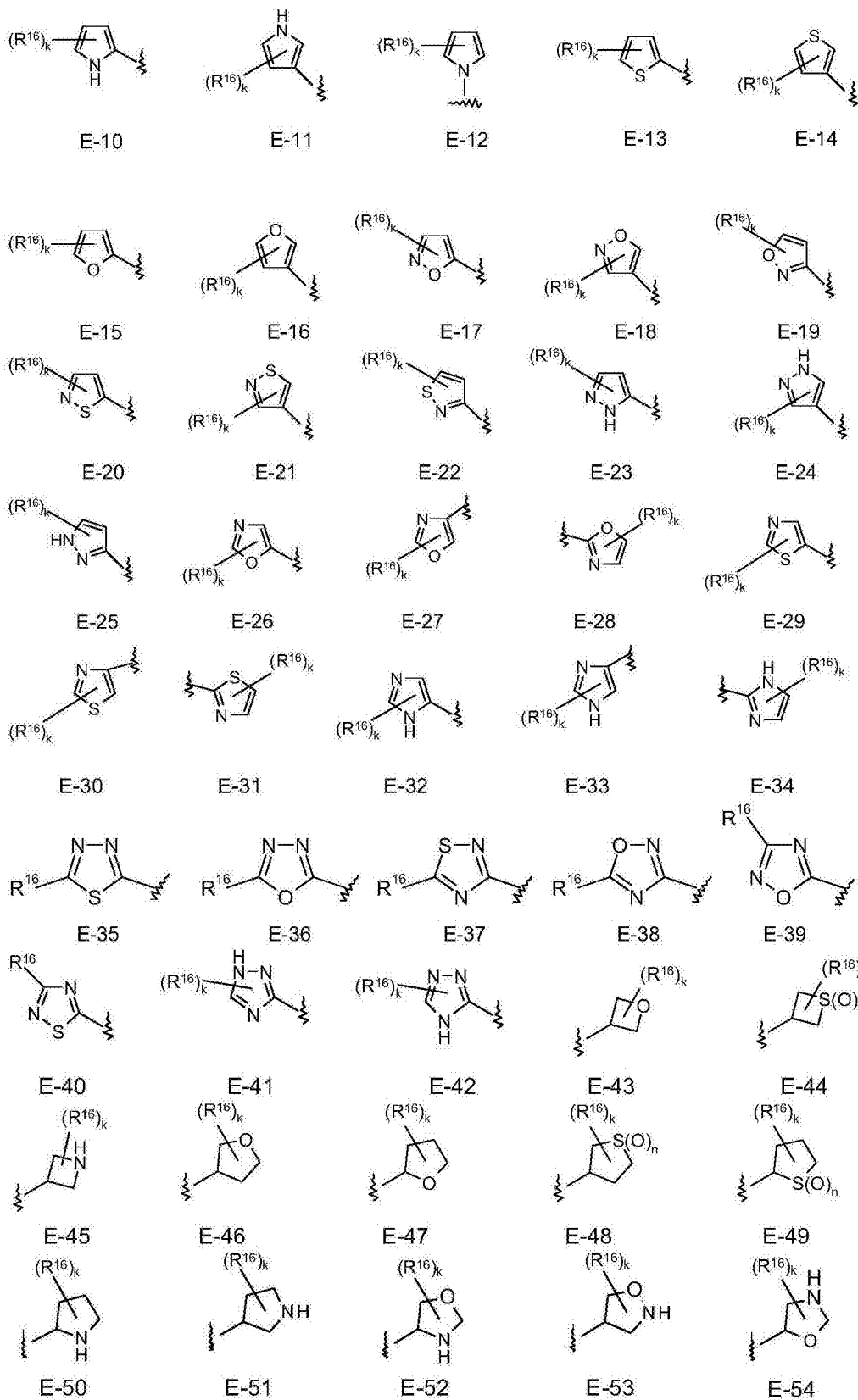
其中

R^{14a} 选自氢, C_1-C_6- 烷基和 C_1-C_6- 卤代烷基;和

R^{14b} 选自氢, C_1-C_6- 烷基, C_1-C_6- 卤代烷基, C_2-C_6- 烯基, C_2-C_6- 卤代烯基, C_2-C_6- 炔基, C_2-C_6- 卤代炔基, C_3-C_6- 环烷基, C_3-C_6- 卤代环烷基, C_3-C_6- 环烷基- C_1-C_4- 烷基-,其中所提及的后3种基团中的环烷基部分可以被氰基取代; C_1-C_6- 烷基,其被CN基团取代, C_1-C_6- 烷氧基, C_1-C_6- 卤代烷氧基, 苯基,其任选被1、2、3或4个取代基取代,所述取代基各自独立选自卤素, 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, C_1-C_4- 烷硫基,

C₁-C₄-卤代烷基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基, C₂-C₄-烯基, C₂-C₄-卤代烯基, C₂-C₄-炔基和C₂-C₄-卤代炔基;和杂环,其选自式E-1至E-54的环,特别是E-1至E-51的环





其中

k 是0、1、2或3，

n 是0、1或2；和

各 R^{16} 独立选自卤素，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, C₁-C₄-烷硫基, C₁-C₄-卤代烷硫基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基, C₂-C₄-烯基, C₂-C₄-卤代烯基, C₂-C₄-炔基和C₂-C₄-卤代炔基;或

饱和环的相同碳原子上存在的两个R¹⁶可以一起形成=O或=S。

5. 权利要求1所要求保护的化合物, 其中A是A²和在A²中W是O。

6. 权利要求1或5所要求保护的化合物, 其中A²中的R^{6a}是-X-R^{6b}, 其中X选自-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(=O)-NH-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-C(=O)-NH-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂S(O)_n-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-S(O)_n-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-O-C(R^a)₂-, 和-C(R^a)₂-C(R^a)₂-O-C(R^a)₂-, 和优选-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(=O)-NH-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-S(O)₂-C(R^a)₂-, 和-C(R^a)₂-C(R^a)₂-O-C(R^a)₂-, 其中各R^a、n和R^{6b}独立地如权利要求1中所定义。

7. 权利要求6所要求保护的化合物, 其中各R^a独立选自氢和甲基和优选是氢。

8. 权利要求5至7中任一项所要求保护的化合物, 其中R⁵选自氢, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-卤代烯基, C₂-C₆-炔基, C₂-C₆-卤代炔基, C₃-C₈-环烷基和C₃-C₈-卤代环烷基, 其中前述的脂族和环脂族残基可以被1、2或3个残基R⁸取代; 优选氢, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-卤代烯基, C₂-C₆-炔基, C₂-C₆-卤代炔基和C₁-C₄-烷基, 其被下述取代: 氰基, C₃-C₈-环烷基或C₁-C₄-烷氧基, 和尤其选自氢和C₁-C₆-烷基; 其中R⁸如权利要求1中所定义。

9. 权利要求5至8中任一项所要求保护的化合物, 其中R^{6b}选自C₂-C₈-烯基, C₂-C₈-卤代烯基, C₂-C₈-炔基, C₂-C₈-卤代炔基, C₃-C₈-环烷基, C₃-C₈-卤代环烷基和被氰基取代的C₃-C₈-环烷基。

10. 权利要求1或5所要求保护的化合物, 其中A²中的R^{6a}是-N(R^{5a})R^{6c}。

11. 权利要求10所要求保护的化合物, 其中R⁵和R^{5a}相互独立地选自氢, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-卤代烯基, C₂-C₆-炔基, C₂-C₆-卤代炔基, C₃-C₈-环烷基和C₃-C₈-卤代环烷基, 其中前述的脂族和环脂族残基可以被1、2或3个残基R⁸取代; 优选氢, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-卤代烯基, C₂-C₆-炔基, C₂-C₆-卤代炔基和C₁-C₄-烷基, 其被下述取代: 氰基, C₃-C₈-环烷基或C₁-C₄-烷氧基, 和尤其选自氢和C₁-C₆-烷基; 其中R⁸如权利要求1中所定义。

12. 权利要求10或11中任一项所要求保护的化合物, 其中R^{6c}选自-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}和-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}, 尤其是-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}, 其中

R^{14a}选自氢和C₁-C₆-烷基; 和

R^{14b}选自氢, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-卤代烯基, C₂-C₆-炔基, C₂-C₆-卤代炔基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基, C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基-, 其中所提及的后3种基团中的环烷基部分可以被氰基取代; 和被CN基团取代的C₁-C₆-烷基; 和其中R^{14b}尤其选自氢, C₁-C₄-烷基和C₁-C₄-卤代烷基。

13. 权利要求1或5所要求保护的化合物, 其中A²中的R⁵是氢和R^{6a}选自氢, 1-氰基环丙基, 1-氰基环丁基和1-氰基环戊基; 或

R⁵和R^{6a}一起形成基团=S(O)_m(R⁹)₂, 其中

R⁹选自C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₃-C₈-环烷基, C₃-C₈-环烷基-C₁-C₄-烷基-, C₃-C₈-卤代环烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-卤代烯基, C₂-C₆-炔基, C₂-C₆-卤代炔基, 苯基和苄基, 其中所提及的后2种基团中的苯基部分可以携带1、2、3、4或5个残基R¹⁶, 其中R¹⁶如权利要求1或4中任

一项所定义；

和其中尤其是 R^{6a} 选自氢和1-氰基环丙基。

14. 权利要求1所要求保护的化合物，其中A是 A^3 并且在 A^3 中

R^{7a} 和 R^{7b} 相互独立地选自氢，氰基， C_1 - C_4 -烷基和 C_1 - C_4 -卤代烷基，和其中优选 R^{7a} 和 R^{7b} 之一是氢而另一个是氢或甲基；

R^5 选自氢， C_1 - C_6 -烷基， C_3 - C_6 -环烷基， C_2 - C_6 -烯基， C_2 - C_6 -炔基，其中所提及的后4种脂族和环脂族残基可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个取代基 R^8 取代；和

R^6 选自氢， C_1 - C_6 -烷基， C_3 - C_6 -环烷基， C_2 - C_6 -烯基， C_2 - C_6 -炔基，其中所提及的后4种脂族和环脂族残基可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个取代基 R^8 取代，

$-OR^9$ ， $-NR^{10a}R^{10b}$ ， $-S(O)_nR^9$ ， $-C(=O)NR^{10a}N(R^{10a}R^{10b})$ ， $-C(=O)R^8$ ，

和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂单环或杂双环环，其含有1、2、3或4个独立选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员，其中所述杂单环或杂双环环可以被一个或多个取代基 R^{11} 取代；或

R^5 和 R^6 与它们结合至的氮原子一起形成3-、4-、5-或6-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环，其中所述环可以还含有1、2、3或4个选自O、S、N、SO、SO₂、C=O和C=S的杂原子或含杂原子基团作为环成员，其中所述杂环可以被1、2、3、4或5个取代基取代，所述取代基独立选自卤素，氰基， C_1 - C_6 -烷基， C_1 - C_6 -卤代烷基， C_1 - C_6 -烷氧基， C_1 - C_6 -卤代烷氧基， C_1 - C_6 -烷硫基， C_1 - C_6 -卤代烷硫基， C_3 - C_8 -环烷基， C_3 - C_8 -卤代环烷基， C_2 - C_6 -烯基， C_2 - C_6 -卤代烯基， C_2 - C_6 -炔基， C_2 - C_6 -卤代炔基，其中所提及的后12种残基中的脂族或环脂族部分可以被一个或多个残基 R^8 取代，和苯基，其可以被1、2、3、4或5个取代基 R^{11} 取代；

其中n， R^8 ， R^9 ， R^{10a} ， R^{10b} 和 R^{11} 如权利要求1中所定义。

15. 权利要求14所要求保护的化合物，其中

R^5 选自氢， C_1 - C_4 -烷基， C_1 - C_4 -卤代烷基， C_2 - C_3 -烯基， C_2 - C_3 -炔基， $-CH_2-CN$ 和 C_1 - C_6 -烷氧基-甲基-和优选氢和 C_1 - C_4 -烷基；和

R^6 是 $-C(=O)R^8$ ；

其中 R^8 如权利要求1中所定义。

16. 权利要求14或15所要求保护的化合物，其中 $-C(=O)R^8$ 中的 R^8 选自氢，氰基， C_1 - C_6 -烷基， C_1 - C_6 -卤代烷基， C_2 - C_3 -烯基， C_2 - C_3 -卤代烯基， C_2 - C_3 -炔基， C_2 - C_3 -卤代炔基， C_3 - C_8 -环烷基， C_3 - C_8 -卤代环烷基， C_3 - C_8 -环烯基， C_3 - C_8 -卤代环烯基，其中所提及的后10种残基中的脂族和环脂族部分可以被一个或多个残基 R^{13} 取代；

$-OR^9$ ， $-S(O)_nR^9$ ， $-N(R^{10a})R^{10b}$ ， $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$ ，

苯基，任选被1、2、3、4或5个取代基 R^{16} 取代，和3-、4-、5-或6-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环，其包含1、2或3个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员，其中所述杂环任选被一个或多个取代基 R^{16} 取代，

其中n， R^9 ， R^{10a} ， R^{10b} ， R^{13} 和 R^{16} 如权利要求1中所定义。

17. 权利要求16所要求保护的化合物，其中 R^8 选自 C_1 - C_6 -烷基， C_1 - C_6 -卤代烷基， C_2 - C_3 -烯基， C_2 - C_3 -卤代烯基， C_2 - C_3 -炔基， C_2 - C_3 -卤代炔基， C_3 - C_8 -环烷基， C_3 - C_8 -卤代环烷基， C_3 - C_8 -环烯基， C_3 - C_8 -卤代环烯基，其中所提及的后10种残基中的脂族和环脂族部分可以被一个或多个残基 R^{13} 取代；

$-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{10a})\text{R}^{10b}$, $-\text{N}(\text{R}^{10a})\text{R}^{10b}$, 苯基, 其任选被1、2、3、4或5个取代基取代, 所述取代基各自独立选自卤素, 氰基, 硝基, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -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, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -卤代环烷基, $\text{C}_2\text{-C}_4$ -烯基, $\text{C}_2\text{-C}_4$ -卤代烯基, $\text{C}_2\text{-C}_4$ -炔基和 $\text{C}_2\text{-C}_4$ -卤代炔基; 和杂环, 其选自如权利要求4中所定义的式E-1至E-54, 特别是E-1至E-51的环,

其中

R^{10a} 和 R^{10b} 相互独立地选自氢, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基, $\text{C}_2\text{-C}_3$ -烯基, $\text{C}_2\text{-C}_3$ -卤代烯基, $\text{C}_2\text{-C}_3$ -炔基, $\text{C}_2\text{-C}_3$ -卤代炔基, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -卤代环烷基, 其中所提及的后8种残基中的脂族和环脂族部分可以被一个或多个残基 R^{13} 取代; 和 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{14a}\text{R}^{14b}$;

R^{13} 选自CN, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷氧基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷氧基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷硫基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷硫基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基亚磺酰基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基亚磺酰基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基磺酰基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基磺酰基, $-\text{NR}^{14a}\text{R}^{14b}$, 和杂环, 其选自如权利要求4中所定义的式E-1至E-54、特别是E-1至E-51的环; 或烷基的相同碳原子上存在的两个 R^{13} 可以一起是 $=\text{NOR}^{17}$; 和优选选自 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷氧基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷氧基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷硫基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷硫基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基磺酰基和 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基磺酰基;

R^{14a} 和 R^{14b} 相互独立地选自氢, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -烯基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -卤代烯基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -炔基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -卤代炔基, 其中所提及的后6种脂族残基可以携带1个取代基, 所述取代基选自氰基, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷氧基, $\text{C}_3\text{-C}_4$ -环烷基, 其可以被1个氰基取代; 和 $\text{C}_3\text{-C}_4$ -卤代环烷基; $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基, 其可以携带1个氰基; $\text{C}_3\text{-C}_8$ -卤代环烷基; 和 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{18a}\text{R}^{18b}$;

各 R^{16} 作为式E-1至E-54的杂环上的取代基独立选自卤素, 氰基, 硝基, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -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, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -卤代环烷基, $\text{C}_2\text{-C}_4$ -烯基, $\text{C}_2\text{-C}_4$ -卤代烯基, $\text{C}_2\text{-C}_4$ -炔基和 $\text{C}_2\text{-C}_4$ -卤代炔基; 或

饱和杂环的相同碳原子上存在的两个 R^{16} 可以一起形成 $=\text{O}$ 或 $=\text{S}$; 和

R^{17} , R^{18a} 和 R^{18b} 相互独立且各次出现独立地选自氢, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -烯基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -卤代烯基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -炔基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -卤代炔基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基, 其携带1个取代基, 所述取代基选自氰基, $\text{C}_3\text{-C}_4$ -环烷基, 其可以被1个氰基取代; 和 $\text{C}_3\text{-C}_4$ -卤代环烷基;

$\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基, 其可以携带1个氰基; 和 $\text{C}_3\text{-C}_8$ -卤代环烷基。

18. 前述权利要求中任一项所要求保护的化合物, 其中 B^1 , B^2 和 B^3 是 CR^2 , 其中 R^2 选自氢, 卤素, 氰基, 叠氮基, 硝基, $-\text{SCN}$, $-\text{SF}_5$, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -烯基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -炔基, 其中所提及的后4种脂族和环脂族残基可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个残基 R^8 取代; $-\text{OR}^9$, $-\text{S}(\text{O})_n\text{R}^9$ 和 $-\text{NR}^{10a}\text{R}^{10b}$,

其中 n , R^8 , R^9 , R^{10a} 和 R^{10b} 如权利要求1中所定义。

19. 权利要求18所要求保护的化合物, 其中 R^2 选自氢, 卤素和 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -卤代烷基, 优选氢, F, Cl, Br和 CF_3 。

20. 前述权利要求中任一项所要求保护的化合物, 其中 G^1 和 G^2 是 CR^4 。

21. 前述权利要求中任一项所要求保护的化合物, 其中 R^4 选自氢, 卤素, 氰基, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷基, $\text{C}_3\text{-C}_5$ -环烷基, $\text{C}_3\text{-C}_5$ -卤代环烷基, $\text{C}_2\text{-C}_4$ -烯基, $\text{C}_2\text{-C}_4$ -卤代烯基, $\text{C}_2\text{-C}_4$ -炔基, $\text{C}_2\text{-C}_4$ -卤代炔基, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷氧基, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷硫基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷硫基, 和尤其是氢。

22. 前述权利要求中任一项所要求保护的化合物, 其中 R^1 选自 C_1 - C_4 -卤代烷基和 $-C(=O)OR^{15}$, 其中 R^{15} 是 C_1 - C_4 -烷基, 和其中 R^1 尤其是 CF_3 。

23. 前述权利要求中任一项所要求保护的化合物, 其中 R^{3a} 和 R^{3b} 相互独立地选自氢和卤素, 优选氢和氟, 和尤其是氢。

24. 农业组合物, 包含至少一种如权利要求1至23中任一项所定义的式I化合物, 其立体异构体和/或至少一种其农业上可接受的盐, 和至少一种惰性液态和/或固态的农业上可接受的载体。

25. 兽医学组合物, 包含至少一种如权利要求1至23中任一项所定义的式I化合物, 其立体异构体和/或至少一种其兽医上可接受的盐, 和至少一种惰性液态和/或固态的兽医学上可接受的载体。

26. 如权利要求1至23中任一项所定义的化合物、立体异构体和/或农业上或其兽医上可接受的盐的用途, 用于抗击无脊椎动物病虫害。

27. 如权利要求1至23中任一项所定义的化合物、立体异构体和/或其兽医上可接受的盐的用途, 用于处理或保护动物免受无脊椎动物病虫害侵染或感染。

28. 防治无脊椎动物病虫害的方法, 所述方法包括用农药有效量的至少一种如权利要求1至23中任一项所定义的式I亚胺化合物、其立体异构体和/或至少一种其农业上可接受的盐处理病虫害、它们的食品供给、它们的生境或它们的育种地, 或者病虫害生长或可以生长于其中的植物、植物繁殖材料、土壤、区域、物质或环境, 或者有待保护使之免于无脊椎动物病虫害侵袭或侵染的物质、植物、植物繁殖材料、土壤、表面或空间。

29. 权利要求28所要求保护的方法, 其用于保护植物免受无脊椎动物病虫害侵袭或侵染, 所述方法包括用农药有效量的至少一种如权利要求1至23中任一项所定义的式I化合物、其立体异构体和/或至少一种其农业上可接受的盐处理植物。

30. 权利要求29所要求保护的方法, 其用于保护植物繁殖材料和/或自其生长的植物免受无脊椎动物病虫害侵袭或侵染, 所述方法包括用农药有效量的至少一种如权利要求1至23中任一项所定义的式I化合物、其立体异构体和/或至少一种其农业上可接受的盐处理植物繁殖材料。

31. 植物繁殖材料, 包含至少一种如权利要求1至23中任一项所定义的式I化合物、其立体异构体和/或至少一种其农业上可接受的盐。

32. 处理或保护动物免受无脊椎动物病虫害侵染或感染的方法, 其包括将动物与农药有效量的至少一种如权利要求1至23中任一项所定义的式I化合物、其立体异构体和/或至少一种其兽医上可接受的盐接触。

萘基-或异噻啉基-取代的异噻唑啉化合物

[0001] 本发明涉及萘基-或异噻啉基-取代的异噻唑啉化合物,其用于抗击或防治无脊椎动物病虫害,尤其是节肢动物病虫害和线虫。本发明也涉及通过使用这些化合物防治无脊椎动物病虫害的方法和涉及植物繁殖材料和涉及包含所述化合物的农业和兽医学组合物。

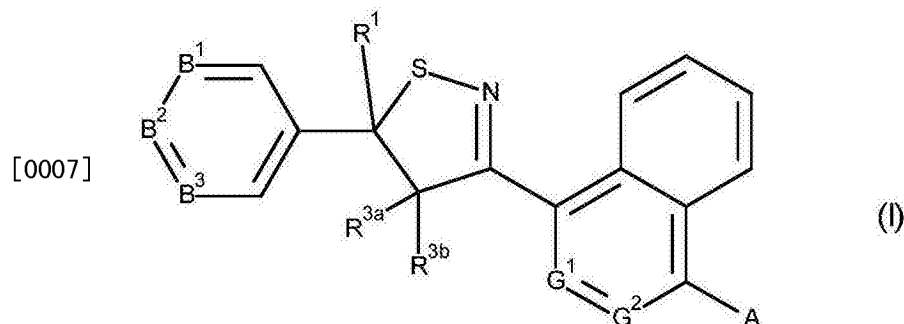
[0002] 无脊椎动物病虫害和尤其是节肢动物和线虫毁坏生长中的作物和已收获的作物,并且侵袭木质住所和商业建筑,导致食品供给和财产的大规模经济损失。虽然已知许多农药试剂,由于靶标病虫害发展出对所述试剂的抗性的能力,持续地需要抗击无脊椎动物病虫害,尤其是昆虫、蛛形动物和线虫的新试剂。

[0003] 有关的杀昆虫的芳基异噻唑啉化合物描述于WO 2013/037626。然而,该文献并未描述具有本发明要求保护的特征的取代基和取代基安排的化合物。有关的杀昆虫的芳基噻啉化合物还描述于WO 2011/092287,WO 2011/073444,WO 2010/090344,WO 2009/112275和WO 97/23212。同样地,这些文献也并未描述具有本发明要求保护的特征的取代基和取代基安排的化合物。

[0004] 本发明的目的在于,提供化合物,其具有良好的农药活性,尤其是杀虫活性,并且显示对许多不同的无脊椎动物病虫害、特别是对难防治的节肢动物病虫害和/或线虫的广谱活性。

[0005] 已发现的是,这些目标能够通过下式I异噻唑啉化合物、通过其立体异构体和通过其盐、尤其是它们的农业上或兽医学上可接受的盐来实现。

[0006] 因此,在第一方面,本发明涉及式I异噻唑啉化合物



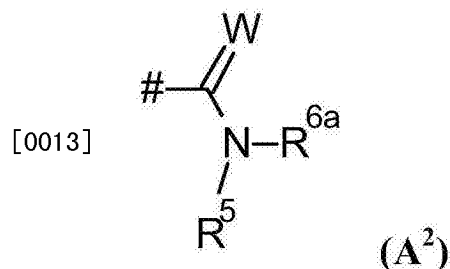
[0008] 其中

[0009] A是基团A¹,A²或A³;

[0010] 其中

[0011] A¹选自-C(=NR⁶)R⁸, -S(O)_nR⁹, -CN和-N(R⁵)R⁶;

[0012] A²是下式的基团:

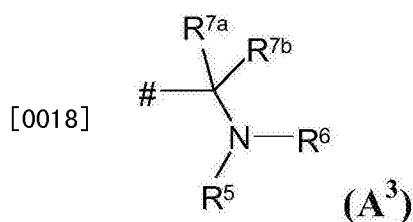


[0014] 其中

[0015] #表示连至分子其余部分的键；

[0016] W选自O和S；

[0017] A³是下式的基团：



[0019] 其中

[0020] #表示连至式(I)芳族环的键；

[0021] B¹, B²和B³各自独立地选自N和CR²,条件是B¹, B²和B³中至多两个是N；

[0022] G¹和G²各自独立地选自N和CR⁴,条件是G¹和G²中至多一个是N；

[0023] R¹选自C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷氧基-C₁-C₄-烷基-, C₂-C₄-烯基, C₂-C₄-卤代烯基, C₂-C₄-炔基, C₂-C₄-卤代炔基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基和-C(=O)OR¹⁵；

[0024] 各R²独立选自氢, 卤素, 氰基, 叠氮基, 硝基, -SCN, -SF₅, C₁-C₆-烷基, C₃-C₈-环烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-炔基, 其中所提及的后4种脂族和环脂族残基可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个残基R⁸取代；

[0025] -Si(R¹²)₃, -OR⁹, -S(O)_nR⁹, 和-NR^{10a}R^{10b}；

[0026] R^{3a}, R^{3b}各自独立选自氢, 卤素, 羟基, -CO₂R^{3d}, C₁-C₃-烷基, C₁-C₃-卤代烷基, C₂-C₃-烯基, C₂-C₃-炔基, C₁-C₃-烷氧基, C₁-C₃-卤代烷氧基, C₁-C₃-烷硫基, C₁-C₃-卤代烷硫基, C₁-C₃-烷基磺酰基和C₁-C₃-卤代烷基磺酰基；或

[0027] R^{3a}和R^{3b}一起形成基团=O, =C(R^{3c})₂, =NOH或=NOCH₃；

[0028] 各R^{3c}独立选自氢, 卤素, CH₃和CF₃；

[0029] R^{3d}选自氢, C₁-C₆-烷基和C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基-；

[0030] 各R⁴独立选自氢, 卤素, 氰基, 叠氮基, 硝基, -SCN, -SF₅, C₁-C₆-烷基, 其可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个残基R⁸取代, C₃-C₈-环烷基, 其可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个残基R⁸取代, C₂-C₆-烯基, 其可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个残基R⁸取代, C₂-C₆-炔基, 其可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个残基R⁸取代；

[0031] -Si(R¹²)₃, -OR⁹, -S(O)_nR⁹, 和-NR^{10a}R^{10b}；

[0032] 各R⁵独立选自氢, C₁-C₁₀-烷基, C₃-C₈-环烷基, C₂-C₁₀-烯基, C₂-C₁₀-炔基, 其中所提及的后4种脂族和环脂族残基可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个取代基R⁸取代；

[0033] R^{6a}选自-X-R^{6b}和-N(R^{5a})R^{6c}；其中

[0034] X选自-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(=O)-NR^{10a}-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-C(=O)-NR^{10a}-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂S(O)_n-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-S(O)_n-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-O-C(R^a)₂-, 和-C(R^a)₂-C(R^a)₂-O-C(R^a)₂-, 其中

- [0035] 各 R^a 独立选自氢,卤素, C_1-C_3 -烷基,和 C_1-C_3 -卤代烷基;
- [0036] R^{5a} 独立具有对 R^5 给定的含义之一;
- [0037] R^{6b} 选自 C_3-C_8 -环烷基, C_2-C_8 -烯基, C_2-C_8 -炔基,其中所提及的后3种残基可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个取代基 R^8 取代;和
- [0038] R^{6c} 选自氢, C_1-C_6 -烷基, C_1-C_6 -卤代烷基, C_3-C_8 -环烷基, C_3-C_8 -卤代环烷基, C_2-C_6 -烯基, C_2-C_6 -卤代烯基, C_2-C_6 -炔基, C_2-C_6 -卤代炔基,其中所提及的后8种残基中的脂族和环脂族部分可以被一个或多个残基 R^{13} 取代; $-C_1-C_6$ -烷基- $C(=O)OR^{15}$, $-C_1-C_6$ -烷基- $C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$, $-C_1-C_6$ -烷基- $C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$, $-C_1-C_6$ -烷基- $C(=NR^{14})N(R^{14a})R^{14b}$, C_1-C_6 -烷氧基, C_1-C_6 -卤代烷氧基, C_1-C_6 -烷硫基, C_1-C_6 -卤代烷硫基,
- [0039] $-S(O)_nR^{15}$, $-S(O)_nN(R^{14a})R^{14b}$, $-C(=O)R^{13}$, $-C(=O)OR^{15}$, $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$, $-C(=S)R^{13}$, $-C(=S)SR^{15}$, $-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$,和 $-C(=NR^{14})R^{13}$;
- [0040] 其中在 R^5 是氢的情况下, R^{6a} 还选自氢,1-氰基环丙基,1-氰基环丁基和1-氰基戊基;或
- [0041] R^5 和 R^{6a} 一起形成基团 $=S(O)_m(R^9)_2$;
- [0042] 各 R^6 独立选自氢,氰基, C_1-C_{10} -烷基, C_3-C_8 -环烷基, C_2-C_{10} -烯基, C_2-C_{10} -炔基,其中所提及的后4种脂族和环脂族残基可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个取代基 R^8 取代,
- [0043] $-OR^9$, $-NR^{10a}R^{10b}$, $-S(O)_nR^9$, $-C(=O)NR^{10a}N(R^{10a}R^{10b})$, $-Si(R^{12})_3$, $-C(=O)R^8$,
- [0044] 苯基,其可以被1、2、3、4或5个取代基 R^{11} 取代,和
- [0045] 3-、4-、5-、6-、7-、8-、9-或10-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂单环或杂双环环,其含有1、2、3或4个独立选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员,其中所述杂单环或杂双环环可以被一个或多个取代基 R^{11} 取代;
- [0046] 或 R^5 和 R^6 或 R^5 和 R^{6a} 与它们结合至的氮原子一起形成3-、4-、5-、6-、7-或8-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环,其中所述环可以还含有1、2、3或4个选自O、S、N、SO、SO₂、C=O和C=S的杂原子或含杂原子基团作为环成员,其中所述杂环可以被1、2、3、4或5个取代基取代,所述取代基独立选自卤素,氰基, C_1-C_6 -烷基, C_1-C_6 -卤代烷基, C_1-C_6 -烷氧基, C_1-C_6 -卤代烷氧基, C_1-C_6 -烷硫基, C_1-C_6 -卤代烷硫基, C_3-C_8 -环烷基, C_3-C_8 -卤代环烷基, C_2-C_6 -烯基, C_2-C_6 -卤代烯基, C_2-C_6 -炔基, C_2-C_6 -卤代炔基,其中所提及的后12种残基中的脂族或环脂族部分可以被一个或多个残基 R^8 取代,和苯基,其可以被1、2、3、4或5个取代基 R^{11} 取代;
- [0047] R^{7a} , R^{7b} 各自独立选自氢,卤素,氰基, C_1-C_6 -烷基, C_3-C_8 -环烷基, C_2-C_6 -烯基和 C_2-C_6 -炔基,其中所提及的后4种脂族和环脂族残基可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个残基 R^8 取代;
- [0048] 各 R^8 独立选自氰基,叠氮基,硝基, $-SCN$, $-SF_5$, C_3-C_8 -环烷基, C_3-C_8 -卤代环烷基, C_3-C_8 -环烯基, C_3-C_8 -卤代环烯基,其中所提及的后4种残基中的环脂族部分可以被一个或多个残基 R^{13} 取代;
- [0049] $-Si(R^{12})_3$, $-OR^9$, $-OSO_2R^9$, $-S(O)_nR^9$, $-N(R^{10a})R^{10b}$, $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$, $-C(=S)N(R^{10a})R^{10b}$, $-C(=O)OR^9$,苯基,任选被1、2、3、4或5个取代基 R^{16} 取代,和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环,其包含1、2或3个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员,其中所述杂环任选被一个或多个取代基 R^{16} 取代,

[0050] 或

[0051] 烷基、烯基、炔基或环烷基的相同碳原子上存在的两个 R^8 一起形成基团 $=O, =C(R^{13})_2; =S; =S(O)_m(R^{15})_2, =S(O)_mR^{15}N(R^{14a})R^{14b}, =NR^{10a}, =NOR^9$; 或 $=NN(R^{10a})R^{10b}$;

[0052] 或

[0053] 两个残基 R^8 与它们键合至的烷基、烯基、炔基或环烷基的碳原子一起形成3-、4-、5-、6-、7-或8-元饱和的或部分不饱和的碳环或杂环, 其中所述杂环包含1、2、3或4个独立选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 和其中所述碳环或杂环任选被一个或多个取代基 R^{16} 取代; 和

[0054] R^8 作为环烷基环上的取代基额外选自C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-卤代烯基, C₂-C₆-炔基和C₂-C₆-卤代炔基, 其中这6种残基中的脂族部分可以被一个或多个残基 R^{13} 取代; 和

[0055] 基团 $-C(=NR^6)R^8$ 和 $-C(=O)R^8$ 中的 R^8 额外选自氢, 卤素, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-卤代烯基, C₂-C₆-炔基和C₂-C₆-卤代炔基, 其中所提及的后6种残基中的脂族部分可以被一个或多个残基 R^{13} 取代;

[0056] 各 R^9 独立选自氢, 氰基, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₃-C₈-环烷基, C₃-C₈-环烷基-C₁-C₄-烷基-, C₃-C₈-卤代环烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-卤代烯基, C₂-C₆-炔基, C₂-C₆-卤代炔基, 其中所提及的后9种残基中的脂族和环脂族部分可以被一个或多个残基 R^{13} 取代,

[0057] $-C_1-C_6$ -烷基- $C(=O)OR^{15}$, $-C_1-C_6$ -烷基- $C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$, $-C_1-C_6$ -烷基- $C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$, $-C_1-C_6$ -烷基- $C(=NR^{14})N(R^{14a})R^{14b}$, $-Si(R^{12})_3$, $-S(O)_nR^{15}$, $-S(O)_nN(R^{14a})R^{14b}$, $-N(R^{10a})R^{10b}$, $-N=C(R^{13})_2$, $-C(=O)R^{13}$, $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$, $-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$, $-C(=O)OR^{15}$, 苯基, 任选被一个或多个取代基 R^{16} 取代; 和

[0058] 3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环, 其包含1、2或3个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环任选被一个或多个取代基 R^{16} 取代; 和

[0059] 基团 $-S(O)_nR^9$ 和 $-OSO_2R^9$ 中的 R^9 额外选自C₁-C₆-烷氧基和C₁-C₆-卤代烷氧基;

[0060] R^{10a}, R^{10b} 相互独立且各次出现独立地选自氢, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₃-C₈-环烷基, C₃-C₈-卤代环烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-卤代烯基, C₂-C₆-炔基, C₂-C₆-卤代炔基, 其中所提及的后8种残基中的脂族和环脂族部分可以被一个或多个残基 R^{13} 取代; $-C_1-C_6$ -烷基- $C(=O)OR^{15}$, $-C_1-C_6$ -烷基- $C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$, $-C_1-C_6$ -烷基- $C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$, $-C_1-C_6$ -烷基- $C(=NR^{14})N(R^{14a})R^{14b}$, C₁-C₆-烷氧基, C₁-C₆-卤代烷氧基, C₁-C₆-烷硫基, C₁-C₆-卤代烷硫基, $-S(O)_nR^{15}$, $-S(O)_nN(R^{14a})R^{14b}$, $-C(=O)R^{13}$, $-C(=O)OR^{15}$, $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$, $-C(=S)R^{13}$, $-C(=S)SR^{15}$, $-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$, $-C(=NR^{14})R^{13}$;

[0061] 苯基, 任选被1、2、3或4个取代基 R^{16} 取代; 和

[0062] 3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环, 其包含1、2、3或4个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环任选被一个或多个取代基 R^{16} 取代;

[0063] 或

[0064] R^{10a} 和 R^{10b} 与它们键合至的氮原子一起形成3-、4-、5-、6-、7-或8-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环, 其中所述杂环可以额外含有一个或两个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的

杂原子或杂原子基团作为环成员,其中所述杂环任选携带一个或多个取代基,所述取代基选自卤素, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₁-C₆-烷氧基, C₁-C₆-卤代烷氧基, C₁-C₆-烷硫基, C₁-C₆-卤代烷硫基, C₃-C₈-环烷基, C₃-C₈-卤代环烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-卤代烯基, C₂-C₆-炔基, C₂-C₆-卤代炔基, 苯基, 任选被1、2、3、4或5个取代基R¹⁶取代, 和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环, 其包含1、2或3个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环任选携带一个或多个取代基R¹⁶; 或R^{10a}和R^{10b}一起形成基团 =C(R¹³)₂, =S(O)_m(R¹⁵)₂, =S(O)_mR¹⁵N(R^{14a})R^{14b}, =NR¹⁴或=NOR¹⁵;

[0065] R¹¹独立选自卤素, 氰基, 叠氮基, 硝基, -SCN, -SF₅, C₁-C₁₀-烷基, C₃-C₈-环烷基, C₂-C₁₀-烯基, C₂-C₁₀-炔基, 其中所提及的后4种脂族和环脂族残基可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个残基R⁸取代,

[0066] -OR⁹, -NR^{10a}R^{10b}, -S(O)_nR⁹, -Si(R¹²)₃;

[0067] 苯基, 任选被1、2、3、4或5个独立选自R¹⁶的取代基取代; 和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的芳族杂环, 其包含1、2、3或4个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环任选被一个或多个独立选自R¹⁶的取代基取代;

[0068] 或不饱和或部分不饱和杂环的相同环碳原子上存在的两个R¹¹可以一起形成基团 =O, =C(R¹³)₂; =S; =S(O)_m(R¹⁵)₂; =S(O)_mR¹⁵N(R^{14a})R^{14b}, =NR¹⁴, =NOR¹⁵, 或=NN(R^{14a})R^{14b};

[0069] 或结合在相邻环原子上的两个R¹¹与它们结合至的环原子一起形成饱和的3-、4-、5-、6-、7-、8-或9-元环, 其中所述环可以含有1或2个选自O、S、N、NR¹⁴、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团和/或1或2个选自C=O, C=S和C=NR¹⁴的基团作为环成员, 和其中所述环可以被一个或多个残基取代, 所述残基选自卤素, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₁-C₆-烷氧基, C₁-C₆-卤代烷氧基, C₁-C₆-烷硫基, C₁-C₆-卤代烷硫基, C₃-C₈-环烷基, C₃-C₈-卤代环烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-卤代烯基, C₂-C₆-炔基, C₂-C₆-卤代炔基, 苯基, 其可以被1、2、3、4或5个残基R¹⁶取代, 和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环, 其含有1、2或3个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环可以被一个或多个残基R¹⁶取代;

[0070] 各R¹²独立选自氢, 卤素, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₁-C₆-烷氧基, C₁-C₆-卤代烷氧基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-卤代烯基, C₂-C₆-炔基, C₂-C₆-卤代炔基, C₃-C₈-环烷基, C₃-C₈-卤代环烷基, C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷氧基-C₁-C₆-烷基, 和苯基, 任选被1、2、3、4或5个取代基R¹⁶取代;

[0071] 各R¹³独立选自氰基, 硝基, -OH, -SH, -SCN, -SF₅, C₁-C₆-烷氧基, C₁-C₆-卤代烷氧基, C₁-C₆-烷硫基, C₁-C₆-卤代烷硫基, C₁-C₆-烷基亚磺酰基, C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基, C₁-C₆-烷基磺酰基, C₁-C₆-卤代烷基磺酰基, -NR^{14a}R^{14b}, -C(=O)NR^{14a}R^{14b}, 三甲基甲硅烷基, 三乙基甲硅烷基, 叔丁基二甲基甲硅烷基,

[0072] C₃-C₈-环烷基, 其可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基, 所述残基选自氰基, C₁-C₄-烷基, C₃-C₄-环烷基, C₁-C₄-烷氧基, C₁-C₄-卤代烷氧基和氧代; 苯基, 苄基, 苯氧基, 其中所提及的后3种残基中的苯基部分可以是未经取代的或携带1、2、3、4或5个取代基R¹⁶; 和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环, 其含有1、2或3个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环可以被

1、2或3个取代基 R^{16} 取代；

[0073] 或

[0074] 烷基、烯基、炔基或环烷基的相同碳原子上存在的两个 R^{13} 可以一起是 $=O$, $=CH$ (C_1 - C_4 -烷基), $=C(C_1$ - C_4 -烷基) C_1 - C_4 -烷基, $=NR^{17}$ 或 $=NOR^{17}$;

[0075] 和

[0076] R^{13} 作为环烷基环上的取代基额外选自 C_1 - C_6 -烷基, C_2 - C_6 -烯基和 C_2 - C_6 -炔基, 其中所提及的后3种脂族残基可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个取代基, 所述取代基选自CN, C_3 - C_4 -环烷基, C_1 - C_4 -烷氧基, C_1 - C_4 -卤代烷氧基和氧代;

[0077] 和

[0078] 基团 $=C(R^{13})_2$, $-N=C(R^{13})_2$, $-C(=O)R^{13}$, $-C(=S)R^{13}$ 和 $-C(=NR^{14})R^{13}$ 中的 R^{13} 额外选自氢, 卤素, C_1 - C_6 -烷基, C_2 - C_6 -烯基和 C_2 - C_6 -炔基, 其中所提及的后3种脂族残基可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基, 所述残基选自CN, C_3 - C_4 -环烷基, C_1 - C_4 -烷氧基, C_1 - C_4 -卤代烷氧基和氧代;

[0079] 各 R^{14} 独立选自氢, 氰基, C_1 - C_6 -烷氧基, C_1 - C_6 -卤代烷氧基, C_1 - C_6 -烷硫基, C_1 - C_6 -卤代烷硫基, C_1 - C_6 -烷基亚磺酰基, C_1 - C_6 -卤代烷基亚磺酰基, C_1 - C_6 -烷基磺酰基, C_1 - C_6 -卤代烷基磺酰基, $-C(=O)NR^{18a}R^{18b}$, 三甲基甲硅烷基, 三乙基甲硅烷基, 叔丁基二甲基甲硅烷基,

[0080] C_1 - C_6 -烷基, C_2 - C_6 -烯基, C_2 - C_6 -炔基, 其中所提及的后3种脂族残基可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基, 所述残基选自CN, C_1 - C_4 -烷氧基, C_1 - C_4 -卤代烷氧基, C_1 - C_4 -烷硫基, C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基, C_1 - C_4 -烷基磺酰基, C_3 - C_4 -环烷基, 其可以被1或2个取代基取代, 所述取代基选自卤素和氰基; 和氧代;

[0081] C_3 - C_8 -环烷基, 其可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基, 所述残基选自氰基, C_1 - C_4 -烷基, C_1 - C_4 -烷氧基, C_1 - C_4 -卤代烷氧基, C_1 - C_4 -烷硫基, C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基, C_1 - C_4 -烷基磺酰基, C_3 - C_4 -环烷基, C_3 - C_4 -环烷基- C_1 - C_4 -烷基-, 其中所提及的后2种残基中的环烷基部分可以被1或2个取代基取代, 所述取代基选自卤素和氰基; 和氧代;

[0082] 苯基, 苄基, 吡啶基, 苯氧基, 其中所提及的后4种残基中的环状部分可以是未经取代的和/或携带1、2或3个取代基, 所述取代基选自卤素, C_1 - C_6 -烷基, C_1 - C_6 -卤代烷基, C_1 - C_6 -烷氧基, C_1 - C_6 -卤代烷氧基和(C_1 - C_6 -烷氧基)羰基; 和3-、4-、5-或6-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环, 其包含1或2个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环任选被一个或多个取代基 R^{16} 取代;

[0083] R^{14a} 和 R^{14b} 相互独立地具有对 R^{14} 给定的含义之一; 或

[0084] R^{14a} 和 R^{14b} 与它们结合至的氮原子一起形成3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环, 其中所述杂环可以额外含有1或2个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环任选携带一个或多个取代基, 所述取代基选自卤素, 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;

[0085] 或

[0086] R^{14a} 和 R^{14} 或 R^{14b} 和 R^{14} 与它们在基团 $-C(=NR^{14})N(R^{14a})R^{14b}$ 中结合至的氮原子一起形成3-、4-、5-、6-或7-元部分不饱和或最大不饱和的杂环, 其中所述杂环可以额外含有1或2个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环任选携带一个

或多个取代基,所述取代基选自卤素,C₁-C₄-卤代烷基,C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷氧基;

[0087] 各R¹⁵独立选自氢,氰基,三甲基甲硅烷基,三乙基甲硅烷基,叔丁基二甲基甲硅烷基,

[0088] C₁-C₆-烷基,C₂-C₆-烯基,C₂-C₆-炔基,其中所提及的后3种脂族残基可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基,所述残基选自C₃-C₄-环烷基,C₁-C₄-烷氧基,C₁-C₄-卤代烷氧基,C₁-C₄-烷硫基,C₁-C₄-烷基亚磺酰基,C₁-C₄-烷基磺酰基和氧代;

[0089] C₃-C₈-环烷基,其可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基,所述残基选自C₁-C₄-烷基,C₃-C₄-环烷基,C₁-C₄-烷氧基,C₁-C₄-卤代烷氧基,C₁-C₄-烷硫基,C₁-C₄-烷基亚磺酰基,C₁-C₄-烷基磺酰基和氧代;

[0090] 苯基,苄基,吡啶基和苯氧基,其中所提及的后4种残基可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或携带1、2或3个取代基,所述取代基选自C₁-C₆-烷基,C₁-C₆-卤代烷基,C₁-C₆-烷氧基,C₁-C₆-卤代烷氧基和(C₁-C₆-烷氧基)羰基;

[0091] 各R¹⁶独立选自卤素,硝基,氰基,-OH,-SH,C₁-C₆-烷氧基,C₁-C₆-卤代烷氧基,C₁-C₆-烷硫基,C₁-C₆-卤代烷硫基,C₁-C₆-烷基亚磺酰基,C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基,C₁-C₆-烷基磺酰基,C₁-C₆-卤代烷基磺酰基,三甲基甲硅烷基,三乙基甲硅烷基,叔丁基二甲基甲硅烷基;

[0092] C₁-C₆-烷基,C₂-C₆-烯基,C₂-C₆-炔基,其中所提及的后3种脂族残基可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基,所述残基选自C₃-C₄-环烷基,C₁-C₄-烷氧基,C₁-C₄-卤代烷氧基和氧代;

[0093] C₃-C₈-环烷基,其可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基,所述残基选自C₁-C₄-烷基,C₃-C₄-环烷基,C₁-C₄-烷氧基,C₁-C₄-卤代烷氧基和氧代;

[0094] 苯基,苄基,吡啶基和苯氧基,其中所提及的后4种残基可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或携带1、2或3个取代基,所述取代基选自C₁-C₆-烷基,C₁-C₆-卤代烷基,C₁-C₆-烷氧基,C₁-C₆-卤代烷氧基和(C₁-C₆-烷氧基)羰基;

[0095] 或

[0096] 不饱和或部分不饱和环的相同原子上存在的两个R¹⁶可以一起是=O,=S,=N(C₁-C₆-烷基),=NO(C₁-C₆-烷基),=CH(C₁-C₄-烷基)或=C(C₁-C₄-烷基)C₁-C₄-烷基;

[0097] 或

[0098] 在两个相邻碳原子上的两个R¹⁶与它们键合至的碳原子一起形成4-、5-、6-、7-或8-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的环,其中所述环可以含有1或2个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员,和其中所述环任选携带一个或多个取代基,所述取代基选自卤素,C₁-C₄-烷基,C₁-C₄-卤代烷基,C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷氧基;和尤其是选自卤素,C₁-C₄-卤代烷基,C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷氧基;

[0099] R¹⁷,R^{18a}和R^{18b}相互独立且各次出现独立地选自氢,C₁-C₆-烷基,C₂-C₆-烯基,C₂-C₆-炔基,其中所提及的后3种脂族残基可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基,所述残基选自CN,C₁-C₄-烷氧基,C₁-C₄-卤代烷氧基,C₁-C₄-烷硫基,C₁-C₄-烷基亚磺酰基,C₁-C₄-烷基磺酰基,C₃-C₄-环烷基,其可以被1或2个取代基取代,所述取代基选自卤素和氰基;和氧代;

[0100] C₃-C₈-环烷基,其可以是未经取代的、部分或完全卤化的和/或可以携带1或2个残基,所述残基选自氰基,C₁-C₄-烷基和C₁-C₄-卤代烷基;

- [0101] 苯基和苄基；
- [0102] 各n独立地是0、1或2；和
- [0103] 各m独立地是0或1；
- [0104] 及其N-氧化物、立体异构体和农业上或兽医学上可接受的盐。
- [0105] 本发明也提供农业组合物，其包含至少一种如本文所定义的式I化合物和/或其农业上可接受的盐和至少一种液体或固体载体。
- [0106] 本发明也提供兽医学组合物，其包含至少一种如本文所定义的式I化合物和/或其兽医上可接受的盐和至少一种液体或固体载体。
- [0107] 本发明也提供防治无脊椎病虫害的方法，该方法包括将病虫害、其食物来源、其生境或其育种地，或栽培植物、植物繁殖材料(比如种子)，土壤，区域，物质或病虫害生长或可以生长的环境，或待保护以免受病虫害侵袭或侵染的物质、栽培植物、植物繁殖材料(比如种子)、土壤、表面或空间用农药有效量的本文定义的式I化合物或其盐。
- [0108] 本发明也涉及植物繁殖材料、尤其是种子，其包含至少一种如本文所定义的式I化合物和/或其农业上可接受的盐。
- [0109] 本发明还涉及处理或保护动物免受寄生物侵染或感染的方法，其包括将动物与杀寄生物有效量的如本文所定义的式I化合物或其兽医上可接受的盐接触。将动物与本发明化合物I、其盐或兽医学接触组合物意指将其施用或给予至动物。
- [0110] 术语“立体异构体”涵盖旋光异构体，比如对映体或非对映体，后者由于分子中多于一个手性中心而存在，以及几何异构体(顺/反异构体)。
- [0111] 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，在此情况下它们作为对映体或非对映体的混合物存在。一个手性中心是携带残基R¹的异噻唑啉环的碳环原子。本发明提供纯对映体或非对映体和它们的混合物，和化合物I的纯对映体或非对映体或其混合物的根据本发明的用途。适宜的式I化合物也包括全部可能的几何立体异构体(顺/反异构体)及其混合物。
- [0112] 术语N-氧化物涉及化合物I的形式，其中至少一个氮原子以氧化形式存在(作为NO)。更确切地，其涉及任何本发明化合物，其具有至少一个氧化为N-氧化物部分的叔氮原子。化合物I的N-氧化物能够尤其是制备如下：用适宜的氧化剂比如过氧羧酸或其它过氧化物来氧化例如异噻唑啉部分的环氮原子，和/或如果G¹或G²是N则包括该氮原子，和/或基团A中存在的任何含氮杂环基团的氮原子。本领域技术人员知晓本发明化合物是否可以并且在何处形成N-氧化物。
- [0113] 本发明化合物可以是无定形或可以以一种或多种不同的结晶状态(多晶型物)存在，其可以具有不同的宏观特性比如稳定性或显示不同的生物学特性比如活性。本发明包括无定形和结晶的式I化合物，各自化合物I的不同结晶状态的混合物，及其无定形或结晶的盐。
- [0114] 式I化合物的盐优选是农业上和兽医学上可接受的盐。它们能够以常规方法形成，例如如果式I化合物具有碱性官能团，则将化合物与有关阴离子的酸反应，或者将酸性的式I化合物与适宜的碱反应。
- [0115] 适宜的农业上可接受的盐尤其是这种阳离子的盐或者这种酸的酸加成盐，其阳离子和阴离子分别对按照本发明的化合物的作用不具有任何有害影响。适宜的阳离子尤其是

碱金属优选锂、钠和钾,碱土金属优选钙、镁和钡,和过渡金属优选锰、铜、锌和铁的离子,以及铵(NH_4^+)和取代的铵,其中氢原子中的1至4个被 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -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、苯基或苄基替换。取代的铵离子的实例包含甲基铵,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;另外磷离子,铈离子,优选三($\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基)铈,和氧化铈离子,优选三($\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基)氧化铈。

[0116] 有用酸加成盐的阴离子主要是氯离子、溴离子、氟离子、硫酸氢根离子、硫酸根离子、磷酸二氢根离子、磷酸氢根离子、磷酸根离子、硝酸根离子、碳酸氢根离子、碳酸根离子、六氟硅酸根离子、六氟磷酸根离子、苯甲酸根离子和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -链烷酸的阴离子,优选甲酸根离子、乙酸根离子、丙酸根离子和丁酸根离子。它们可以通过将式I化合物与相应阴离子的酸反应来形成,优选盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸或硝酸。

[0117] 术语“兽医学上可接受的盐”意指本领域已知且接受用于形成兽医学用途的盐的那些阳离子或阴离子的盐。适宜的酸加成盐,例如含有碱性氮原子、例如氨基的式I化合物形成的酸加成盐,包括与无机酸例如盐酸盐,硫酸盐,磷酸盐和硝酸盐形成的盐与有机酸例如乙酸、马来酸、马来酸一氢酸(dimalic acid)、富马酸、富马酸一氢酸(difumaric acid)、甲烷次磺酸、甲烷磺酸和丁二酸形成的盐。

[0118] 术语“无脊椎动物病虫害”如本文所用涵盖动物群体比如昆虫、蛛形动物和线虫,其可以侵袭植物,由此导致受侵袭植物的实质损害;以及外寄生物,其可以侵染动物尤其是温血动物比如哺乳动物或鸟类,或其它更高级的动物比如爬行动物、两栖动物或鱼类,由此导致受侵染动物的实质损害。

[0119] 术语“植物繁殖材料”应理解为表示全部植物的生殖部分比如种子和无性植物材料比如插条和块茎(例如马铃薯),其能够用于植物的增殖。其包括种子,根,果实,块茎,鳞茎,根茎,茎枝,籽苗和在发芽之后或在出苗之后待从土壤移植的其它植物部分、包括幼苗和秧苗。植物繁殖材料可以在种植或移植时或在其之前用植物保护化合物预防性地处理。所述秧苗还可以在移植之前通过全部和/或部分浸入或浇注处理加以保护。

[0120] 术语“植物”包含任意类型的植物,包括“非栽培植物”和尤其是“栽培植物”。

[0121] 术语“非栽培植物”是指任意野生型种类或栽培植物的有关种或有关属。

[0122] 术语“栽培植物”应理解为包括已通过育种、诱变或基因工程改造加以修饰的植物,包括但不限于市场上的或开发中的农业生物技术产品(参考http://www.bio.org/speeches/pubs/er/agri_products.asp)。转基因植物是这样的植物,其遗传材料已通过使用重组DNA技术修饰,所述修饰在天然环境下不易通过杂交育种、突变或天然重组获得。一般地,一个或多个基因已整合入转基因植物的遗传材料以改善所述植物的某些特性。所述基因修饰也包括但不限于蛋白质、寡肽或多肽的靶向翻译后修饰,例如通过糖基化或聚合物加成比如异戊二烯基化的、乙酰化的或法呢基化的部分或PEG部分。

[0123] 已通过育种、诱变或基因工程改造修饰的植物例如已经耐受特定类除草剂的施用,比如植物生长素除草剂比如麦草畏或2,4-D;漂白剂除草剂比如羟基苯基丙酮酸加双氧酶(HPPD)抑制剂或八氢番茄红素去饱和酶(PDS)抑制剂;乙酰乳酸合成酶(ALS)抑制剂比如磺酰基脲或咪唑啉酮;烯醇丙酮基莽草酸酯-3-磷酸合成酶(EPSPS)抑制剂,比如草甘膦;谷

氨酰胺合成酶(GS)抑制剂比如草铵膦;原卟啉原-IX氧化酶抑制剂;脂质生物合成抑制剂比如乙酰基CoA羧化酶(ACC酶)抑制剂;或苯腈(oxynil)(即溴苯腈或碘苯腈)除草剂,这是育种或基因工程改造传统方法的结果。另外,植物已通过多种基因修饰变得抗多类除草剂,比如抗草甘膦和草铵膦两者或者抗草甘膦和另一类除草剂两者,所述另一类除草剂是比如ALS抑制剂、HPPD抑制剂、植物生长素除草剂或ACC酶抑制剂。这些除草剂抗性技术例如描述于Pest Managem.Sci.61,2005,246;61,2005,258;61,2005,277;61,2005,269;61,2005,286;64,2008,326;64,2008,332;Weed Sci.57,2009,108;Austral.J.Agricult.Res.58,2007,708;Science 316,2007,1185;及其中所引的参考文献。数种栽培植物已通过常规育种方法(诱变)变得耐受除草剂,例如**Clearfield**[®]夏季油菜(Canola,BASF SE,德国)耐受咪唑啉酮例如甲氧咪草烟,或**ExpressSun**[®]向日葵(DuPont,USA)耐受磺酰基脲例如苯磺隆。基因工程改造方法已用来使得栽培植物比如大豆、棉花、玉米、甜菜和油菜耐受除草剂比如草甘膦和草铵膦,其中一些是以商品名**RoundupReady**[®](耐受草甘膦,Monsanto,U.S.A.),**Cultivance**[®](耐受咪唑啉酮,BASF SE,德国)和**LibertyLink**[®](耐受草铵膦,Bayer CropScience,德国)可商购的。

[0124] 此外,植物还涵盖通过使用重组DNA技术能够合成一种或多种杀昆虫蛋白的那些,所述蛋白特别是自细菌芽孢杆菌属(*Bacillus*),特别苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*)已知的那些,比如 δ -内毒素,例如CryIA(b),CryIA(c),CryIF,CryIF(a2),CryIIA(b),CryIIIA,CryIIIB(b1)或Cry9c;植物性杀昆虫蛋白(VIP),例如VIP1,VIP2,VIP3或VIP3A;细菌移居线虫的杀昆虫蛋白,例如光杆状菌属(*Photorhabdus* spp.)或致病杆菌属(*Xenorhabdus* spp.);动物产生的毒素比如蝎毒素、蛛形动物毒素、蜂毒素或其它昆虫特异性神经毒素;真菌产生的毒素比如链霉菌毒素,植物凝集素,比如豌豆或大麦凝集素;凝集素;蛋白酶抑制剂,比如胰蛋白酶抑制剂,丝氨酸蛋白酶抑制剂,patatin,半胱氨酸蛋白酶抑制剂或木瓜蛋白酶抑制剂;核糖体失活蛋白(RIP),比如蓖麻毒素,玉米-RIP,相思豆毒蛋白,软瓜蛋白,肥皂草毒蛋白或异株泻根毒蛋白;类固醇代谢酶,比如3-羟类固醇氧化酶,蜕皮甾类-IDP-糖基-转移酶,胆固醇氧化酶,蜕皮素抑制剂或HMG-CoA-还原酶;离子通道阻断剂,比如钠通道或钙通道阻断剂;保幼激素酯酶;利尿激素受体(helicokinin受体);萜合成酶,联苄合成酶,几丁质酶或葡聚糖酶。在本发明的上下文中,这些杀昆虫蛋白或毒素应理解还是前毒素、杂交蛋白、截短或者修饰的蛋白。杂交蛋白是特征是蛋白质区域的新组合(参见例如W002/015701)。所述毒素或能够合成所述毒素的转基因植物的进一步实例公开于例如EP-A 374 753,W0 93/007278,W0 95/34656,EP-A 427 529,EP-A 451 878,W0 03/18810和W0 03/52073。产生所述转基因植物的方法一般是本领域技术人员已知的且描述于例如上述公开内容中。包含于转基因植物的这些杀虫蛋白质赋予产生这些蛋白质的植物对有害病虫害的耐受,所述病虫害来自全部分类学类别的节肢动物,特别是甲虫(鞘翅目(*Coeloptera*)),双翅昆虫(双翅目(*Diptera*)),和蛾(鳞翅目(*Lepidoptera*))和线虫(线虫纲(*Nematoda*))。能够合成一种或多种杀虫蛋白质的转基因植物例如描述于上文提及的公开并且其中的一些是可商购的,比如**YieldGard**[®](玉米栽培种,产生Cry1Ab毒素),**YieldGard**[®]Plus(玉米栽培种,产生Cry1Ab和Cry3Bb1毒素),**Starlink**[®](玉米栽培种,产

生Cry9c毒素), **Herculex**[®] RW(玉米栽培种,产生Cry34Ab1, Cry35Ab1和草铵膦(phosphinothricin)-N-乙酰转移酶[PAT]); **NuCOTN**[®] 33B(棉花栽培种,产生Cry1Ac毒素), **Bollgard**[®] I(棉花栽培种,产生Cry1Ac毒素), **Bollgard**[®] II(棉花栽培种,产生Cry1Ac和Cry2Ab2毒素); **VIPCOT**[®] (棉花栽培种,产生VIP-毒素); **NewLeaf**[®] (马铃薯栽培种,产生Cry3A毒素); **Bt-Xtra**[®], **NatureGard**[®], **Knockout**[®], **BiteGard**[®], **Protecta**[®], Bt11(例如**Agrisure**[®] CB)和Bt176,来自Syngenta Seeds SAS法国(玉米栽培种,产生Cry1Ab毒素和PAT酶),MIR604,来自Syngenta Seeds SAS法国(玉米栽培种,产生修饰形式的Cry3A毒素,参照WO 03/018810),MON 863,来自Monsanto Europe S.A.比利时(玉米栽培种,产生Cry3Bb1毒素),IPC 531,来自Monsanto Europe S.A.比利时(棉花栽培种,产生修饰形式的Cry1Ac毒素)和1507,来自Pioneer Overseas Corporation比利时(玉米栽培种,产生Cry1F毒素和PAT酶)。

[0125] 另外,植物也涵盖那些,其通过使用重组DNA技术能够合成一种或多种蛋白质,以增加那些植物对细菌、病毒或真菌病原体的抗性或耐受。所述蛋白质的实例是所谓的“发病机理-相关性蛋白质”(PR蛋白质,参见例如EP-A 392 225),植物病害抗性基因(例如马铃薯栽培种,其表达对致病疫霉(*Phytophthora infestans*)的抗性基因,所述致病疫霉衍生自墨西哥野生马铃薯*Solanum bulbocastanum*)或T4-溶菌酶(例如能够合成这些蛋白质的马铃薯栽培种,其具有对细菌比如解淀粉杆菌(*Erwinia amylovora*)的增加抗性)。产生所述转基因植物的方法一般是本领域技术人员已知的且描述于例如上述公开内容中。

[0126] 另外,植物也涵盖那些,其通过使用重组DNA技术能够合成一种或多种蛋白质,以增加生产能力(例如生物量产生、谷物收率、淀粉含量、油含量或蛋白质含量),对于干旱、盐度或其它生长限制性环境因素的耐受或者对那些植物的病虫害和真菌、细菌或病毒病原体的耐受。

[0127] 另外,植物也涵盖那些,其通过使用重组DNA技术含有修饰量的内容物质或新的内容物质,特别是改善人类或动物营养,例如产生健康促进性长链 ω -3脂肪酸或不饱和 ω -9脂肪酸的油料作物(例如**Nexera**[®]油菜,DOW Agro Sciences,加拿大)。

[0128] 另外,植物也涵盖那些,其通过使用重组DNA技术含有修饰量的内容物质或新的内容物质,特别是改善原料产生,例如产生增加量支链淀粉的马铃薯(例如**Amflora**[®]马铃薯,BASF SE,德国)。

[0129] 在变量上述定义中提及的有机部分是-比如术语卤素-单独基团成员的单独列表的集合术语。前缀C_n-C_m在各情况下是指基团中碳原子的可能个数。

[0130] 术语卤素在各情况下表示氟,溴,氯或碘,尤其是氟,氯或溴。

[0131] 如本文所用和在烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基羰基、烷氧羰基等的烷基部分中的术语“烷基”是指饱和直链或支化的烃残基,具有1至2个(“C₁-C₂-烷基”),1至3个(“C₁-C₃-烷基”),1至4个(“C₁-C₄-烷基”),1至6个(“C₁-C₆-烷基”),1至8个(“C₁-C₈-烷基”)或1至10个(“C₁-C₁₀-烷基”)碳原子。C₁-C₂-烷基是甲基或乙基。C₁-C₃-烷基额外地是丙基和异丙基。C₁-C₄-烷基额外地是丁基,1-甲基丙基(仲丁基),2-甲基丙基(异丁基)或1,1-

二甲基乙基(叔丁基)。C₁-C₆-烷基额外地还是例如戊基,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,1,1-二甲基丙基,1,2-二甲基丙基,己基,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,或1-乙基-2-甲基丙基。C₁-C₈-烷基额外地还是例如庚基,辛基,2-乙基己基及其位置异构体。C₁-C₁₀-烷基额外地还是例如壬基,癸基及其位置异构体。

[0132] 术语“卤代烷基”如本文所用(其也表示为“烷基,其是部分或完全卤化的”)是指直链或支化的烷基,具有1至2个(“C₁-C₂-卤代烷基”),1至3个(“C₁-C₃-卤代烷基”),1至4个(“C₁-C₄-卤代烷基”),1至6个(“C₁-C₆-卤代烷基”),1至8个(“C₁-C₈-卤代烷基”)或1至10个(“C₁-C₁₀-卤代烷基”)碳原子(如上文所提及),其中这些基团中的某些或全部氢原子被如上文所提及的卤素原子替换:尤其是C₁-C₂-卤代烷基比如氯甲基,溴甲基,二氯甲基,三氯甲基,氟甲基,二氟甲基,三氟甲基,氯氟甲基,二氯氟甲基,氯二氟甲基,1-氯乙基,1-溴乙基,1-氟乙基,2-氟乙基,2,2-二氟乙基,2,2,2-三氟乙基,2-氯-2-氟乙基,2-氯-2,2-二氟乙基,2,2-二氯-2-氟乙基,2,2,2-三氯乙基或五氟乙基。C₁-C₃-卤代烷基额外地是例如1-氟丙基,2-氟丙基,3-氟丙基,1,1-二氟丙基,2,2-二氟丙基,1,2-二氟丙基,3,3-二氟丙基,3,3,3-三氟丙基,七氟丙基,1,1,1-三氟丙-2-基,3-氯丙基等。除了对C₁-C₃-卤代烷基提及的那些,C₁-C₄-卤代烷基的实例是4-氯丁基等。

[0133] “卤代甲基”是甲基,其中氢原子中的1、2或3个被卤素原子替换。实例是溴甲基,氯甲基,氟甲基,二氯甲基,三氯甲基,二氟甲基,三氟甲基,氯氟甲基,二氯氟甲基,氯二氟甲基等。

[0134] 术语“烯基”如本文所用是指单不饱和的直链或支化的烃残基,具有2至3个(“C₂-C₃-烯基”),2至4个(“C₂-C₄-烯基”),2至6个(“C₂-C₆-烯基”),2至8个(“C₂-C₈-烯基”)或2至10个(“C₂-C₁₀-烯基”)碳原子和任意位置的双键,例如C₂-C₃-烯基,比如乙烯基,1-丙烯基,2-丙烯基或1-甲基乙烯基;C₂-C₄-烯基,比如乙烯基,1-丙烯基,2-丙烯基,1-甲基乙烯基,1-丁烯基,2-丁烯基,3-丁烯基,1-甲基-1-丙烯基,2-甲基-1-丙烯基,1-甲基-2-丙烯基或2-甲基-2-丙烯基;C₂-C₆-烯基,比如乙烯基,1-丙烯基,2-丙烯基,1-甲基乙烯基,1-丁烯基,2-丁烯基,3-丁烯基,1-甲基-1-丙烯基,2-甲基-1-丙烯基,1-甲基-2-丙烯基,2-甲基-2-丙烯基,1-戊烯基,2-戊烯基,3-戊烯基,4-戊烯基,1-甲基-1-丁烯基,2-甲基-1-丁烯基,3-甲基-1-丁烯基,1-甲基-2-丁烯基,2-甲基-2-丁烯基,3-甲基-2-丁烯基,1-甲基-3-丁烯基,2-甲基-3-丁烯基,3-甲基-3-丁烯基,1,1-二甲基-2-丙烯基,1,2-二甲基-1-丙烯基,1,2-二甲基-2-丙烯基,1-乙基-1-丙烯基,1-乙基-2-丙烯基,1-己烯基,2-己烯基,3-己烯基,4-己烯基,5-己烯基,1-甲基-1-戊烯基,2-甲基-1-戊烯基,3-甲基-1-戊烯基,4-甲基-1-戊烯基,1-甲基-2-戊烯基,2-甲基-2-戊烯基,3-甲基-2-戊烯基,4-甲基-2-戊烯基,1-甲基-3-戊烯基,2-甲基-3-戊烯基,3-甲基-3-戊烯基,4-甲基-3-戊烯基,1-甲基-4-戊烯基,2-甲基-4-戊烯基,3-甲基-4-戊烯基,4-甲基-4-戊烯基,1,1-二甲基-2-丁烯基,1,1-二甲基-3-丁烯基,1,2-二甲基-1-丁烯基,1,2-二甲基-2-丁烯基,1,2-二甲基-3-丁烯基,1,3-二甲基-1-丁烯基,1,3-二甲基-2-丁烯基,1,3-二甲基-3-丁烯基,2,2-二甲基-3-丁烯基,2,3-二甲基-1-丁烯基,2,3-二甲基-2-丁烯基,2,3-二甲基-3-丁烯基,3,3-二甲基-1-丁烯基,3,3-

二甲基-2-丁烯基,1-乙基-1-丁烯基,1-乙基-2-丁烯基,1-乙基-3-丁烯基,2-乙基-1-丁烯基,2-乙基-2-丁烯基,2-乙基-3-丁烯基,1,1,2-三甲基-2-丙烯基,1-乙基-1-甲基-2-丙烯基,1-乙基-2-甲基-1-丙烯基,1-乙基-2-甲基-2-丙烯基等,或 C_2-C_{10} -烯基,比如对 C_2-C_6 -烯基提及的残基和额外地1-庚烯基,2-庚烯基,3-庚烯基,1-辛烯基,2-辛烯基,3-辛烯基,4-辛烯基,1-壬烯基,2-壬烯基,3-壬烯基,4-壬烯基,1-癸烯基,2-癸烯基,3-癸烯基,4-癸烯基,5-癸烯基及其位置异构体。

[0135] 术语“卤代烯基”如本文所用(其也表示为“烯基,其是部分或完全卤化的”)是指不饱和的直链或支化的烃残基,具有2至3个(“ C_2-C_3 -卤代烯基”),2至4个(“ C_2-C_4 -卤代烯基”),2至6个(“ C_2-C_6 -卤代烯基”),2至8个(“ C_2-C_8 -卤代烯基”)或2至10个(“ C_2-C_{10} -卤代烯基”)碳原子和在任意位置的双键(如上文所提及),其中这些基团中的某些或全部氢原子被如上文所提及的卤素原子尤其是氟、氯和溴替换,例如氯乙烯基,氯烯丙基等。

[0136] 术语“炔基”如本文所用是指直链或支化的烃基团,具有2至3个(“ C_2-C_3 -炔基”),2至4个(“ C_2-C_4 -炔基”),2至6个(“ C_2-C_6 -炔基”),2至8个(“ C_2-C_8 -炔基”),或2至10个(“ C_2-C_{10} -炔基”)碳原子和在任意位置的1个或2个三键,例如 C_2-C_3 -炔基,比如乙炔基,1-丙炔基或2-丙炔基; C_2-C_4 -炔基,比如乙炔基,1-丙炔基,2-丙炔基,1-丁炔基,2-丁炔基,3-丁炔基,1-甲基-2-丙炔基等, C_2-C_6 -炔基,比如乙炔基,1-丙炔基,2-丙炔基,1-丁炔基,2-丁炔基,3-丁炔基,1-甲基-2-丙炔基,1-戊炔基,2-戊炔基,3-戊炔基,4-戊炔基,1-甲基-2-丁炔基,1-甲基-3-丁炔基,2-甲基-3-丁炔基,3-甲基-1-丁炔基,1,1-二甲基-2-丙炔基,1-乙基-2-丙炔基,1-己炔基,2-己炔基,3-己炔基,4-己炔基,5-己炔基,1-甲基-2-戊炔基,1-甲基-3-戊炔基,1-甲基-4-戊炔基,2-甲基-3-戊炔基,2-甲基-4-戊炔基,3-甲基-1-戊炔基,3-甲基-4-戊炔基,4-甲基-1-戊炔基,4-甲基-2-戊炔基,1,1-二甲基-2-丁炔基,1,1-二甲基-3-丁炔基,1,2-二甲基-3-丁炔基,2,2-二甲基-3-丁炔基,3,3-二甲基-1-丁炔基,1-乙基-2-丁炔基,1-乙基-3-丁炔基,2-乙基-3-丁炔基,1-乙基-1-甲基-2-丙炔基等;

[0137] 术语“卤代炔基”如本文所用(其也表示为“炔基,其是部分或完全卤化的”)是指不饱和的直链或支化的烃残基,具有2至3个(“ C_2-C_3 -卤代炔基”),2至4个(“ C_2-C_4 -卤代炔基”),3至4个(“ C_3-C_4 -卤代炔基”),2至6个(“ C_2-C_6 -卤代炔基”),2至8个(“ C_2-C_8 -卤代炔基”)或2至10个(“ C_2-C_{10} -卤代炔基”)碳原子和在任意位置的1个或2个三键(如上文所提及),其中这些基团中的某些或全部氢原子被如上文所提及的卤素原子尤其是氟、氯和溴替换;

[0138] 术语“环烷基”如本文所用是指单环或双环或多环饱和的烃残基,具有3至8个(“ C_3-C_8 -环烷基”),尤其是3至6个(“ C_3-C_6 -环烷基”)或3至5个(“ C_3-C_5 -环烷基”)或3至4个(“ C_3-C_4 -环烷基”)碳原子。具有3至4个碳原子的单环残基的实例包含环丙基和环丁基。具有3至5个碳原子的单环残基的实例包含环丙基,环丁基和环戊基。具有3至6个碳原子的单环残基的实例包含环丙基,环丁基,环戊基和环己基。具有3至8个碳原子的单环残基的实例包含环丙基,环丁基,环戊基,环己基,环庚基和环辛基。具有7或8个碳原子的双环残基的实例包含二环[2.2.1]庚基,二环[3.1.1]庚基,二环[2.2.2]辛基和二环[3.2.1]辛基。优选,术语环烷基表示单环饱和烃残基。

[0139] 术语“卤代环烷基”如本文所用(其也表示为“环烷基,其是部分或完全卤化的”)是指单环或双环或多环饱和的烃基团,具有3至8个(“ C_3-C_8 -卤代环烷基”)或优选3至6个(“ C_3-C_6 -卤代环烷基”)或3至5个(“ C_3-C_5 -卤代环烷基”)或3至4个(“ C_3-C_4 -卤代环烷基”)碳环成员

(如上文所提及),其中某些或全部氢原子被如上文所提及的卤素原子尤其是氟、氯和溴替换。

[0140] 术语“环烷基-C₁-C₄-烷基”是指如前文所定义的C₃-C₈-环烷基(“C₃-C₈-环烷基-C₁-C₄-烷基”),优选C₃-C₆-环烷基(“C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基”),更优选C₃-C₄-环烷基(“C₃-C₄-环烷基-C₁-C₄-烷基”)(优选单环环烷基),其经由如前文所定义的C₁-C₄-烷基结合至分子残余部分。C₃-C₄-环烷基-C₁-C₄-烷基的实例是环丙基甲基,环丙基乙基,环丙基丙基,环丁基甲基,环丁基乙基和环丁基丙基;除了对C₃-C₄-环烷基-C₁-C₄-烷基提及的那些,C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基的实例是环戊基甲基,环戊基乙基,环戊基丙基,环己基甲基,环己基乙基和环己基丙基。除了对C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基提及的那些,C₃-C₈-环烷基-C₁-C₄-烷基的实例是环庚基甲基,环庚基乙基,环辛基甲基等。

[0141] 术语“C₃-C₈-卤代环烷基-C₁-C₄-烷基”是指如前文所定义的C₃-C₈-卤代环烷基,其经由如前文所定义的C₁-C₄-烷基结合至分子的残余部分。

[0142] 术语“环烯基”如本文所用是指单环烃残基,环中具有至少一个C-C双键然而该环并非芳族,所述烃残基具有3至8个(“C₃-C₈-环烷基”)碳原子。实例是环丙烯基,比如环丙-1-烯基和环丙-2-基,环丁烯基,比如环丁-1-烯基和环丁-2-烯基,环戊烯基,比如环戊-1-烯基,环戊-2-烯基和环戊-3-烯基,环戊二烯基,比如环戊二烯并-1,3-二烯基,环戊-1,4-二烯基和环戊-2,4-二烯基,环己烯基,比如环己-1-烯基,环己-2-烯基和环己-3-烯基,环己二烯基,比如环己-1,3-二烯基,环己-1,4-二烯基,环己-1,5-二烯基和环己-2,5-二烯基,环庚烯基,环庚二烯基,环庚三烯基,环辛烯基,环辛二烯基,环辛三烯基和环辛四烯基。

[0143] 术语“卤代环烯基”如本文所用是指单环烃残基,环中具有至少一个C-C双键然而该环并非芳族,烃残基具有3至8个(“C₃-C₈-卤代环烷基”)碳原子,和其中某些或全部氢原子被如上文所提及的卤素原子尤其是氟、氯和溴替换。

[0144] 术语“C₁-C₂-烷氧基”是如前文所定义C₁-C₂-烷基,其通过氧原子连接。术语“C₁-C₃-烷氧基”是如前文所定义的C₁-C₃-烷基,其通过氧原子连接。术语“C₁-C₄-烷氧基”是如前文所定义的C₁-C₄-烷基,其通过氧原子连接。术语“C₁-C₆-烷氧基”是如前文所定义的C₁-C₆-烷基,其通过氧原子连接。术语“C₁-C₁₀-烷氧基”是如前文所定义的C₁-C₁₀-烷基,通过氧原子连接。C₁-C₂-烷氧基是甲氧基或乙氧基。C₁-C₃-烷氧基额外地是例如正丙氧基和1-甲基乙氧基(异丙氧基)。C₁-C₄-烷氧基额外地是例如丁氧基,1-甲基丙氧基(仲丁氧基),2-甲基丙氧基(异丁氧基)或1,1-二甲基乙氧基(叔丁氧基)。C₁-C₆-烷氧基额外地是例如戊氧基,1-甲基丁氧基,2-甲基丁氧基,3-甲基丁氧基,1,1-二甲基丙氧基,1,2-二甲基丙氧基,2,2-二甲基丙氧基,1-乙基丙氧基,己氧基,1-甲基戊氧基,2-甲基戊氧基,3-甲基戊氧基,4-甲基戊氧基,1,1-二甲基丁氧基,1,2-二甲基丁氧基,1,3-二甲基丁氧基,2,2-二甲基丁氧基,2,3-二甲基丁氧基,3,3-二甲基丁氧基,1-乙基丁氧基,2-乙基丁氧基,1,1,2-三甲基丙氧基,1,2,2-三甲基丙氧基,1-乙基-1-甲基丙氧基或1-乙基-2-甲基丙氧基。C₁-C₈-烷氧基额外地是例如庚基氧基,辛基氧基,2-乙基己氧基及其位置异构体。C₁-C₁₀-烷氧基额外地是例如壬基氧基,癸基氧基及其位置异构体。

[0145] 术语“C₁-C₂-卤代烷氧基”是如前文所定义的C₁-C₂-卤代烷基,其通过氧原子连接。术语“C₁-C₃-卤代烷氧基”是如前文所定义的C₁-C₃-卤代烷基,其通过氧原子连接。术语“C₁-C₄-卤代烷氧基”是如前文所定义的C₁-C₄-卤代烷基,其通过氧原子连接。术语“C₁-C₆-卤代烷

氧基”是如前文所定义的C₁-C₆-卤代烷基,其通过氧原子连接。术语“C₁-C₁₀-卤代烷氧基”是如前文所定义的C₁-C₁₀-卤代烷基,其通过氧原子连接。C₁-C₂-卤代烷氧基是例如OCH₂F, OCHF₂, OCF₃, OCH₂Cl, OCHCl₂, OCCl₃, 氯氟甲氧基, 二氯氟甲氧基, 氯二氟甲氧基, 2-氟乙氧基, 2-氯乙氧基, 2-溴乙氧基, 2-碘乙氧基, 2,2-二氟乙氧基, 2,2,2-三氟乙氧基, 2-氯-2-氟乙氧基, 2-氯-2,2-二氟乙氧基, 2,2-二氯-2-氟乙氧基, 2,2,2-三氯乙氧基或OC₂F₅。C₁-C₃-卤代烷氧基额外地是例如2-氟丙氧基, 3-氟丙氧基, 2,2-二氟丙氧基, 2,3-二氟丙氧基, 2-氯丙氧基, 3-氯丙氧基, 2,3-二氯丙氧基, 2-溴丙氧基, 3-溴丙氧基, 3,3,3-三氟丙氧基, 3,3,3-三氯丙氧基, OCH₂-C₂F₅, OCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-氟乙氧基, 1-(CH₂Cl)-2-氯乙氧基或1-(CH₂Br)-2-溴乙氧基。C₁-C₄-卤代烷氧基额外地是例如4-氟丁氧基, 4-氯丁氧基, 4-溴丁氧基或九氟丁氧基。C₁-C₆-卤代烷氧基额外地是例如5-氟戊氧基, 5-氯戊氧基, 5-溴戊氧基, 5-碘戊氧基, 十一氟戊氧基, 6-氟己氧基, 6-氯己氧基, 6-溴己氧基, 6-碘己氧基或十二氟己氧基。

[0146] 术语“C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基”如本文所用是指具有1至3个碳原子的直链或支化的烷基,如前文所定义,其中1个氢原子被如前文所定义的C₁-C₃-烷氧基替换。术语“C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基”如本文所用是指具有1至4个碳原子的直链或支化的烷基,如前文所定义,其中1个氢原子被如前文所定义的C₁-C₄-烷氧基替换。术语“C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基”如本文所用是指具有1至6个碳原子的直链或支化的烷基,如前文所定义,其中1个氢原子被如前文所定义的C₁-C₆-烷氧基替换。实例是甲氧基甲基,乙氧基甲基,丙氧基甲基,异丙氧基甲基,正丁氧基甲基,仲丁氧基甲基,异丁氧基甲基,叔丁氧基甲基,1-甲氧基乙基,1-乙氧基乙基,1-丙氧基乙基,1-异丙氧基乙基,1-正丁氧基乙基,1-仲丁氧基乙基,1-异丁氧基乙基,1-叔丁氧基乙基,2-甲氧基乙基,2-乙氧基乙基,2-丙氧基乙基,2-异丙氧基乙基,2-正丁氧基乙基,2-仲丁氧基乙基,2-异丁氧基乙基,2-叔丁氧基乙基,1-甲氧基丙基,1-乙氧基丙基,1-丙氧基丙基,1-异丙氧基丙基,1-正丁氧基丙基,1-仲丁氧基丙基,1-异丁氧基丙基,1-叔丁氧基丙基,2-甲氧基丙基,2-乙氧基丙基,2-丙氧基丙基,2-异丙氧基丙基,2-正丁氧基丙基,2-仲丁氧基丙基,2-异丁氧基丙基,2-叔丁氧基丙基,3-甲氧基丙基,3-乙氧基丙基,3-丙氧基丙基,3-异丙氧基丙基,3-正丁氧基丙基,3-仲丁氧基丙基,3-异丁氧基丙基,3-叔丁氧基丙基等。

[0147] 术语“C₁-C₄-烷氧基-甲基”如本文所用是指甲基,其中1个氢原子被如前文所定义的C₁-C₄-烷氧基替换。术语“C₁-C₆-烷氧基-甲基”如本文所用是指甲基,其中1个氢原子被如前文所定义的C₁-C₆-烷氧基替换。实例是甲氧基甲基,乙氧基甲基,丙氧基甲基,异丙氧基甲基,正丁氧基甲基,仲丁氧基甲基,异丁氧基甲基,叔丁氧基甲基,戊基氧基甲基,己氧基甲基等。

[0148] C₁-C₆-卤代烷氧基-C₁-C₆-烷基是直链或支化的烷基,具有1至6个、特别是1至4个碳原子(=C₁-C₆-卤代烷氧基-C₁-C₄-烷基),其中氢原子之一被C₁-C₆-烷氧基替换和其中至少一个例如1、2、3、4或全部剩余氢原子(在烷氧基部分中或在烷基部分中或在两者中)被卤素原子替换。C₁-C₄-卤代烷氧基-C₁-C₄-烷基是直链或支化的烷基,具有1至4个碳原子,其中氢原子之一被C₁-C₄-烷氧基替换和其中至少一个例如1、2、3、4或全部剩余氢原子(在烷氧基部分中或在烷基部分中或在两者中)被卤素原子替换。实例是二氟甲氧基甲基(CHF₂OCH₂), 三氟甲氧基甲基,1-二氟甲氧基乙基,1-三氟甲氧基乙基,2-二氟甲氧基乙基,2-三氟甲氧基乙基。

基乙基,二氟-甲氧基-甲基(CH_3OCF_2),1,1-二氟-2-甲氧基乙基,2,2-二氟-2-甲氧基乙基等。

[0149] 术语“ $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷硫基”是如前文所定义的 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基,其通过硫原子连接。术语“ $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷硫基”是如前文所定义的 $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基,其通过硫原子连接。术语“ $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷硫基”是如前文所定义的 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基,其通过硫原子连接。术语“ $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷硫基”是如前文所定义的 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基,其通过硫原子连接。术语“ $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -烷硫基”是如前文所定义的 $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -烷基,其通过硫原子连接。 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷硫基是甲硫基或乙硫基。 $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷硫基额外地是例如正丙硫基或1-甲基乙硫基(异丙硫基)。 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷硫基额外地是例如丁硫基,1-甲基丙硫基(仲丁硫基),2-甲基丙硫基(异丁硫基)或1,1-二甲基乙硫基(叔丁硫基)。 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷硫基额外地是例如戊基硫基,1-甲基丁硫基,2-甲基丁硫基,3-甲基丁硫基,1,1-二甲基丙硫基,1,2-二甲基丙硫基,2,2-二甲基丙硫基,1-乙基丙硫基,己基硫基,1-甲基戊基硫基,2-甲基戊基硫基,3-甲基戊基硫基,4-甲基戊基硫基,1,1-二甲基丁硫基,1,2-二甲基丁硫基,1,3-二甲基丁硫基,2,2-二甲基丁硫基,2,3-二甲基丁硫基,3,3-二甲基丁硫基,1-乙基丁硫基,2-乙基丁硫基,1,1,2-三甲基丙硫基,1,2,2-三甲基丙硫基,1-乙基-1-甲基丙硫基或1-乙基-2-甲基丙硫基。 $\text{C}_1\text{-C}_8$ -烷硫基额外地是例如庚基硫基,辛基硫基,2-乙基己基硫基及其位置异构体。 $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -烷硫基额外地是例如壬基硫基,癸基硫基及其位置异构体。

[0150] 术语“ $\text{C}_1\text{-C}_2$ -卤代烷硫基”是如前文所定义的 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -卤代烷基,其通过硫原子连接。术语“ $\text{C}_1\text{-C}_3$ -卤代烷硫基”是如前文所定义的 $\text{C}_1\text{-C}_3$ -卤代烷基,其通过硫原子连接。术语“ $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷硫基”是如前文所定义的 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷基,其通过硫原子连接。术语“ $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷硫基”是如前文所定义的 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基,其通过硫原子连接。术语“ $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -卤代烷硫基”是如前文所定义的 $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -卤代烷基,其通过硫原子连接。 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -卤代烷硫基是例如 SCH_2F , SCHF_2 , SCF_3 , SCH_2Cl , SCHCl_2 , SCCl_3 , 氯氟甲硫基,二氯氟甲硫基,氯二氟甲硫基,2-氟乙硫基,2-氯乙硫基,2-溴乙硫基,2-碘乙硫基,2,2-二氟乙硫基,2,2,2-三氟乙硫基,2-氯-2-氟乙硫基,2-氯-2,2-二氟乙硫基,2,2-二氯-2-氟乙硫基,2,2,2-三氯乙硫基或 SC_2F_5 。 $\text{C}_1\text{-C}_3$ -卤代烷硫基额外地是例如2-氟丙硫基,3-氟丙硫基,2,2-二氟丙硫基,2,3-二氟丙硫基,2-氯丙硫基,3-氯丙硫基,2,3-二氯丙硫基,2-溴丙硫基,3-溴丙硫基,3,3,3-三氟丙硫基,3,3,3-三氯丙硫基, $\text{SCH}_2\text{-C}_2\text{F}_5$, $\text{SCF}_2\text{-C}_2\text{F}_5$, 1-(CH_2F)-2-氟乙硫基,1-(CH_2Cl)-2-氯乙硫基或1-(CH_2Br)-2-溴乙硫基。 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷硫基额外地是例如4-氟丁硫基,4-氯丁硫基,4-溴丁硫基或九氟丁硫基。 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷硫基额外地是例如5-氟戊基硫基,5-氯戊基硫基,5-溴戊基硫基,5-碘戊基硫基,十一氟戊基硫基,6-氟己基硫基,6-氯己基硫基,6-溴己基硫基,6-碘己基硫基或十二氟己基硫基。

[0151] 术语“ $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基亚磺酰基”是如前文所定义的 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基,其通过亚磺酰基[S(0)]基团连接。术语“ $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基亚磺酰基”是如前文所定义的 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基,其通过亚磺酰基[S(0)]基团连接。术语“ $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基亚磺酰基”是如前文所定义的 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基,其通过亚磺酰基[S(0)]基团连接。术语“ $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -烷基亚磺酰基”是如前文所定义的 $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -烷基,其通过亚磺酰基[S(0)]基团连接。 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基亚磺酰基是甲基亚磺酰基或乙基亚磺酰基。 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基亚磺酰基额外地是例如正丙基亚磺酰基,1-甲基乙基亚磺酰基(异丙基亚磺酰基),丁基亚磺酰基,1-甲基丙基亚磺酰基(仲丁基亚磺酰基),2-甲基丙基亚磺酰基(异丁基亚磺酰基)或1,1-二甲基乙基亚磺酰基(叔丁基亚磺酰基)。 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基亚磺酰基额外地是例如戊基亚

磺酰基,1-甲基丁基亚磺酰基,2-甲基丁基亚磺酰基,3-甲基丁基亚磺酰基,1,1-二甲基丙基亚磺酰基,1,2-二甲基丙基亚磺酰基,2,2-二甲基丙基亚磺酰基,1-乙基丙基亚磺酰基,己基亚磺酰基,1-甲基戊基亚磺酰基,2-甲基戊基亚磺酰基,3-甲基戊基亚磺酰基,4-甲基戊基亚磺酰基,1,1-二甲基丁基亚磺酰基,1,2-二甲基丁基亚磺酰基,1,3-二甲基丁基亚磺酰基,2,2-二甲基丁基亚磺酰基,2,3-二甲基丁基亚磺酰基,3,3-二甲基丁基亚磺酰基,1-乙基丁基亚磺酰基,2-乙基丁基亚磺酰基,1,1,2-三甲基丙基亚磺酰基,1,2,2-三甲基丙基亚磺酰基,1-乙基-1-甲基丙基亚磺酰基或1-乙基-2-甲基丙基亚磺酰基。 C_1 - C_8 -烷基亚磺酰基额外地是例如庚基亚磺酰基,辛基亚磺酰基,2-乙基己基亚磺酰基及其位置异构体。 C_1 - C_{10} -烷基亚磺酰基额外地是例如壬基亚磺酰基,癸基亚磺酰基及其位置异构体。

[0152] 术语“ C_1 - C_2 -卤代烷基亚磺酰基”是如前文所定义的 C_1 - C_2 -卤代烷基,其通过亚磺酰基[S(O)]基团连接。术语“ C_1 - C_4 -卤代烷基亚磺酰基”是如前文所定义的 C_1 - C_4 -卤代烷基,其通过亚磺酰基[S(O)]基团连接。术语“ C_1 - C_6 -卤代烷基亚磺酰基”是如前文所定义的 C_1 - C_6 -卤代烷基,其通过亚磺酰基[S(O)]基团连接。术语“ C_1 - C_{10} -卤代烷基亚磺酰基”是如前文所定义的 C_1 - C_{10} -卤代烷基,其通过亚磺酰基[S(O)]基团连接。 C_1 - C_2 -卤代烷基亚磺酰基是例如S(O)CH₂F, S(O)CHF₂, S(O)CF₃, S(O)CH₂Cl, S(O)CHCl₂, S(O)CCl₃, 氯氟甲基亚磺酰基, 二氯氟甲基亚磺酰基, 氯二氟甲基亚磺酰基, 2-氟乙基亚磺酰基, 2-氯乙基亚磺酰基, 2-溴乙基亚磺酰基, 2-碘乙基亚磺酰基, 2,2-二氟乙基亚磺酰基, 2,2,2-三氟乙基亚磺酰基, 2-氯-2-氟乙基亚磺酰基, 2-氯-2,2-二氟乙基亚磺酰基, 2,2-二氯-2-氟乙基亚磺酰基, 2,2,2-三氯乙基亚磺酰基或S(O)C₂F₅。 C_1 - C_4 -卤代烷基亚磺酰基额外地是例如2-氟丙基亚磺酰基, 3-氟丙基亚磺酰基, 2,2-二氟丙基亚磺酰基, 2,3-二氟丙基亚磺酰基, 2-氯丙基亚磺酰基, 3-氯丙基亚磺酰基, 2,3-二氯丙基亚磺酰基, 2-溴丙基亚磺酰基, 3-溴丙基亚磺酰基, 3,3,3-三氟丙基亚磺酰基, 3,3,3-三氯丙基亚磺酰基, S(O)CH₂-C₂F₅, S(O)CF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-氟乙基亚磺酰基, 1-(CH₂Cl)-2-氯乙基亚磺酰基, 1-(CH₂Br)-2-溴乙基亚磺酰基, 4-氟丁基亚磺酰基, 4-氯丁基亚磺酰基, 4-溴丁基亚磺酰基或九氟丁基亚磺酰基。 C_1 - C_6 -卤代烷基亚磺酰基额外地是例如5-氟戊基亚磺酰基, 5-氯戊基亚磺酰基, 5-溴戊基亚磺酰基, 5-碘戊基亚磺酰基, 十一氟戊基亚磺酰基, 6-氟己基亚磺酰基, 6-氯己基亚磺酰基, 6-溴己基亚磺酰基, 6-碘己基亚磺酰基或十二氟己基亚磺酰基。

[0153] 术语“ C_1 - C_2 -烷基磺酰基”是如前文所定义的 C_1 - C_2 -烷基,其通过磺酰基[S(O)₂]基团连接。术语“ C_1 - C_3 -烷基磺酰基”是如前文所定义的 C_1 - C_3 -烷基,其通过磺酰基[S(O)₂]基团连接。术语“ C_1 - C_4 -烷基磺酰基”是如前文所定义的 C_1 - C_4 -烷基,其通过磺酰基[S(O)₂]基团连接。术语“ C_1 - C_6 -烷基磺酰基”是如前文所定义的 C_1 - C_6 -烷基,其通过磺酰基[S(O)₂]基团连接。术语“ C_1 - C_{10} -烷基磺酰基”是如前文所定义的 C_1 - C_{10} -烷基,其通过磺酰基[S(O)₂]基团连接。 C_1 - C_2 -烷基磺酰基是甲磺酰基或乙基磺酰基。 C_1 - C_3 -烷基磺酰基额外地是例如正丙基磺酰基或1-甲基乙基磺酰基(异丙基磺酰基)。 C_1 - C_4 -烷基磺酰基额外地是例如丁基磺酰基, 1-甲基丙基磺酰基(仲丁基磺酰基), 2-甲基丙基磺酰基(异丁基磺酰基)或1,1-二甲基乙基磺酰基(叔丁基磺酰基)。 C_1 - C_6 -烷基磺酰基额外地是例如戊基磺酰基, 1-甲基丁基磺酰基, 2-甲基丁基磺酰基, 3-甲基丁基磺酰基, 1,1-二甲基丙基磺酰基, 1,2-二甲基丙基磺酰基, 2,2-二甲基丙基磺酰基, 1-乙基丙基磺酰基, 己基磺酰基, 1-甲基戊基磺酰基, 2-甲基戊基磺酰基, 3-甲基戊基磺酰基, 4-甲基戊基磺酰基, 1,1-二甲基丁基磺酰基, 1,2-二甲基丁基磺

酰基,1,3-二甲基丁基磺酰基,2,2-二甲基丁基磺酰基,2,3-二甲基丁基磺酰基,3,3-二甲基丁基磺酰基,1-乙基丁基磺酰基,2-乙基丁基磺酰基,1,1,2-三甲基丙基磺酰基,1,2,2-三甲基丙基磺酰基,1-乙基-1-甲基丙基磺酰基或1-乙基-2-甲基丙基磺酰基。 C_1 - C_8 -烷基磺酰基额外地是例如庚基磺酰基,辛基磺酰基,2-乙基己基磺酰基及其位置异构体。 C_1 - C_{10} -烷基磺酰基额外地是例如壬基磺酰基,癸基磺酰基及其位置异构体。

[0154] 术语“ C_1 - C_2 -卤代烷基磺酰基”是如前文所定义的 C_1 - C_2 -卤代烷基,其通过磺酰基 $[S(O)_2]$ 基团连接。术语“ C_1 - C_3 -卤代烷基磺酰基”是如前文所定义的 C_1 - C_3 -卤代烷基,其通过磺酰基 $[S(O)_2]$ 基团连接。术语“ C_1 - C_4 -卤代烷基磺酰基”是如前文所定义的 C_1 - C_4 -卤代烷基,其通过磺酰基 $[S(O)_2]$ 基团连接。术语“ C_1 - C_6 -卤代烷基磺酰基”是如前文所定义的 C_1 - C_6 -卤代烷基,其通过磺酰基 $[S(O)_2]$ 基团连接。术语“ C_1 - C_{10} -卤代烷基磺酰基”是如前文所定义的 C_1 - C_{10} -卤代烷基,其通过磺酰基 $[S(O)_2]$ 基团连接。 C_1 - C_2 -卤代烷基磺酰基是例如 $S(O)_2CH_2F$, $S(O)_2CHF_2$, $S(O)_2CF_3$, $S(O)_2CH_2Cl$, $S(O)_2CHCl_2$, $S(O)_2CCl_3$, 氯氟甲磺酰基,二氯氟甲磺酰基,氯二氟甲基磺酰基,2-氟乙基磺酰基,2-氯乙基磺酰基,2-溴乙基磺酰基,2-碘乙基磺酰基,2,2-二氟乙基磺酰基,2,2,2-三氟乙基磺酰基,2-氯-2-氟乙基磺酰基,2-氯-2,2-二氟乙基磺酰基,2,2-二氯-2-氟乙基磺酰基,2,2,2-三氯乙基磺酰基或 $S(O)_2C_2F_5$ 。 C_1 - C_3 -卤代烷基磺酰基额外地是例如2-氟丙基磺酰基,3-氟丙基磺酰基,2,2-二氟丙基磺酰基,2,3-二氟丙基磺酰基,2-氯丙基磺酰基,3-氯丙基磺酰基,2,3-二氯丙基磺酰基,2-溴丙基磺酰基,3-溴丙基磺酰基,3,3,3-三氟丙基磺酰基,3,3,3-三氯丙基磺酰基, $S(O)_2CH_2-C_2F_5$, $S(O)_2CF_2-C_2F_5$, 1-(CH_2F)-2-氟乙基磺酰基,1-(CH_2Cl)-2-氯乙基磺酰基或1-(CH_2Br)-2-溴乙基磺酰基。 C_1 - C_4 -卤代烷基磺酰基额外地是例如4-氟丁基磺酰基,4-氯丁基磺酰基,4-溴丁基磺酰基或九氟丁基磺酰基。 C_1 - C_6 -卤代烷基磺酰基额外地是例如5-氟戊基磺酰基,5-氯戊基磺酰基,5-溴戊基磺酰基,5-碘戊基磺酰基,十一氟戊基磺酰基,6-氟己基磺酰基,6-氯己基磺酰基,6-溴己基磺酰基,6-碘己基磺酰基或十二氟己基磺酰基。

[0155] 取代基“氧代”通过 $C(=O)$ 基团替换 CH_2 基团。

[0156] 术语“烷基羰基”是 C_1 - C_6 -烷基(“ C_1 - C_6 -烷基羰基”)、优选 C_1 - C_4 -烷基(“ C_1 - C_4 -烷基羰基”)基团,如前文所定义,其通过羰基 $[C(=O)]$ 基团连接。实例是乙酰基(甲基羰基),丙酰基(乙基羰基),丙基羰基,异丙基羰基,正丁基羰基等。

[0157] 术语“卤代烷基羰基”是 C_1 - C_6 -卤代烷基(“ C_1 - C_6 -卤代烷基羰基”)、优选 C_1 - C_4 -卤代烷基(“ C_1 - C_4 -卤代烷基羰基”)基团,如前文所定义,其通过羰基 $[C(=O)]$ 基团连接。实例是三氟甲基羰基,2,2,2-三氟乙基羰基等。

[0158] 术语“烷氧羰基”是 C_1 - C_6 -烷氧基(“ C_1 - C_6 -烷氧羰基”)、优选 C_1 - C_4 -烷氧基(“ C_1 - C_4 -烷氧羰基”)基团,如前文所定义,其通过羰基 $[C(=O)]$ 基团连接。实例是甲氧羰基,乙氧基羰基,丙氧基羰基,异丙氧基羰基,正丁氧基羰基等。

[0159] 术语“卤代烷氧羰基”是 C_1 - C_6 -卤代烷氧基(“ C_1 - C_6 -卤代烷氧羰基”)、优选 C_1 - C_4 -卤代烷氧基(“ C_1 - C_4 -卤代烷氧羰基”)基团,如前文所定义,其通过羰基 $[C(=O)]$ 基团连接。实例是三氟甲氧基羰基,2,2,2-三氟乙氧基羰基等。

[0160] 术语“ C_1 - C_6 -烷基氨基”是基团 $-N(H)C_1-C_6$ -烷基。实例是甲基氨基,乙基氨基,丙基氨基,异丙基氨基,丁基氨基等。

[0161] 术语“二-(C_1 - C_6 -烷基)氨基”是基团 $-N(C_1-C_6-烷基)_2$ 。实例是二甲基氨基,二乙基

氨基,乙基甲基氨基,二丙基氨基,二异丙基氨基,甲基丙基氨基,甲基异丙基氨基,乙基丙基氨基,乙基异丙基氨基,二丁基氨基等。

[0162] 术语“3-、4-、5-、6-、7-、8-、9-或10-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环,其含有1、2或3(或4)个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员”表示3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂单环环或8-、9-或10-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂双环环,其含有1、2或3(或4)个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员。

[0163] 不饱和的环含有至少一个C-C和/或C-N和/或N-N双键。最大不饱和的环含有环大小所允许的个数的共轭C-C和/或C-N和/或N-N双键。最大不饱和的5-或6-元杂环是芳族。杂环可以经由碳环成员或经由氮环成员连接至分子的残余部分。当然,杂环含有至少一个碳环原子。如果环含有多于一个O环原子,则它们是不相邻的。

[0164] 术语“3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环,其含有1、2或3(或4)个选自N、O、S、NO、SO和SO₂杂原子或杂原子基团作为环成员”[其中“最大不饱和的”也包括“芳族”]如本文所用表示单环残基,所述单环残基是饱和、部分不饱和或最大不饱和的(包括芳族)。术语“3-、4-、5-、6-、7-或8-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环,其含有1、2或3(或4)个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员”[其中“最大不饱和的”也包括“芳族”]如本文所用也涵盖8-元杂单环残基,其含有1、2或3(或4)个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员,所述单环残基是饱和、部分不饱和或最大不饱和的(包括芳族)。不饱和的环含有至少一个C-C和/或C-N和/或N-N双键。最大不饱和的环含有环大小所允许的个数的共轭的C-C和/或C-N和/或N-N双键。最大不饱和的5-或6-元杂环是芳族。7-和8-元环不可以是芳族。它们是同芳香性(7元环,3个双键)的或具有4个双键(8-元环)。杂环可以经由碳环成员或经由氮环成员连接至分子的残余部分。当然,杂环含有至少一个碳环原子。如果环含有多于一个O环原子,则它们是不相邻的。

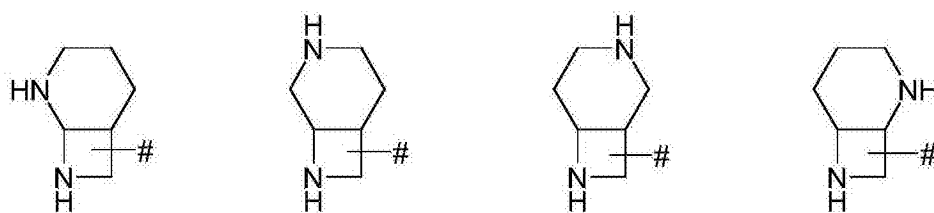
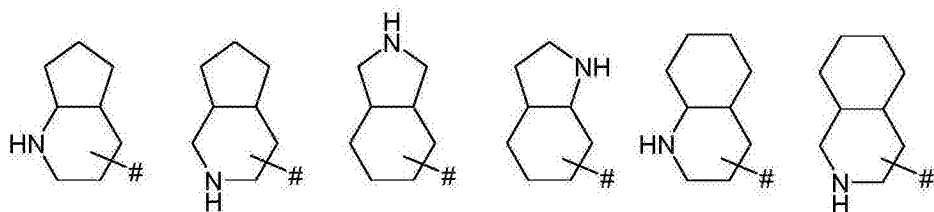
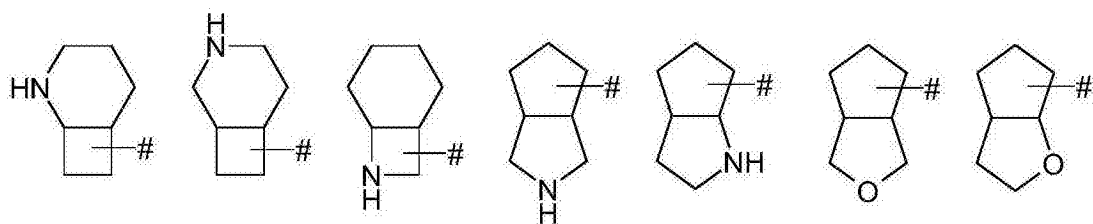
[0165] 3-、4-、5-、6-或7-元饱和杂环的实例包括:环氧乙烷基,硫杂环丙烷基,氮丙啶基,氧杂环丁烷基,硫杂环丁烷基,氮杂环丁烷基,四氢呋喃-2-基,四氢呋喃-3-基,四氢噻吩-2-基,四氢噻吩-3-基,吡咯烷-1-基,吡咯烷-2-基,吡咯烷-3-基,吡唑烷-1-基,吡唑烷-3-基,吡唑烷-4-基,吡唑烷-5-基,咪唑烷-1-基,咪唑烷-2-基,咪唑烷-4-基,噁唑烷-2-基,噁唑烷-3-基,噁唑烷-4-基,噁唑烷-5-基,异噁唑烷-2-基,异噁唑烷-3-基,异噁唑烷-4-基,异噁唑烷-5-基,噻唑烷-2-基,噻唑烷-3-基,噻唑烷-4-基,噻唑烷-5-基,异噻唑烷-2-基,异噻唑烷-3-基,异噻唑烷-4-基,异噻唑烷-5-基,1,2,4-氧杂二唑烷-3-基,1,2,4-氧杂二唑烷-5-基,1,2,4-噻二唑烷-3-基,1,2,4-噻二唑烷-5-基,1,2,4-三唑烷-3-基,1,3,4-氧杂二唑烷-2-基,1,3,4-噻二唑烷-2-基,1,3,4-三唑烷-1-基,1,3,4-三唑烷-2-基,2-四氢吡喃基,4-四氢吡喃基,1,3-二噁烷-5-基,1,4-二噁烷-2-基,哌啶-1-基,哌啶-2-基,哌啶-3-基,哌啶-4-基,六氢哒嗪-3-基,六氢哒嗪-4-基,六氢嘧啶-2-基,六氢嘧啶-4-基,六氢嘧啶-5-基,哌嗪-1-基,哌嗪-2-基,1,3,5-六氢三嗪-1-基,1,3,5-六氢三嗪-2-基和1,2,4-六氢三嗪-3-基,吗啉-2-基,吗啉-3-基,吗啉-4-基,硫吗啉-2-基,硫吗啉-3-基,硫吗啉-4-基,1-氧代硫吗啉-2-基,1-氧代硫吗啉-3-基,1-氧代硫吗啉-4-基,1,1-二氧代硫吗啉-2-基,1,1-二氧代硫吗啉-3-基,1,1-二氧代硫吗啉-4-基,氮杂环庚烷-1-、-2-、-3-或-4-基,氧杂环庚烷-2-、-3-、-4-或-5-基,六氢-1,3-二氮杂^草基,六氢-1,4-二氮杂^草基,六氢-1,

3-氧氮杂^草基,六氢-1,4-氧氮杂^草基,六氢-1,3-二氧杂^草基,六氢-1,4-二氧杂^草基等。

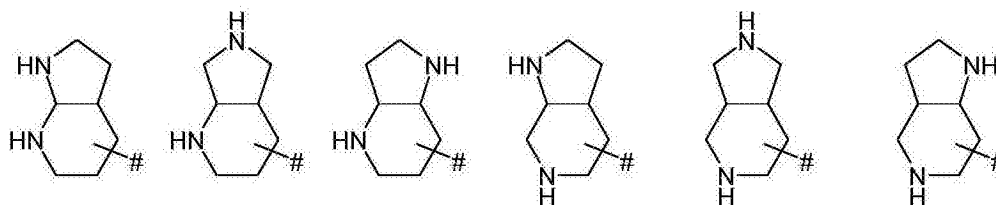
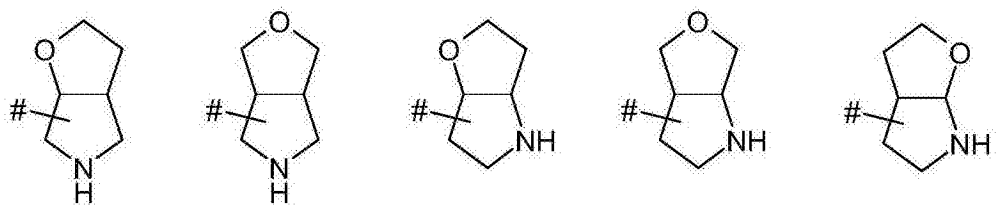
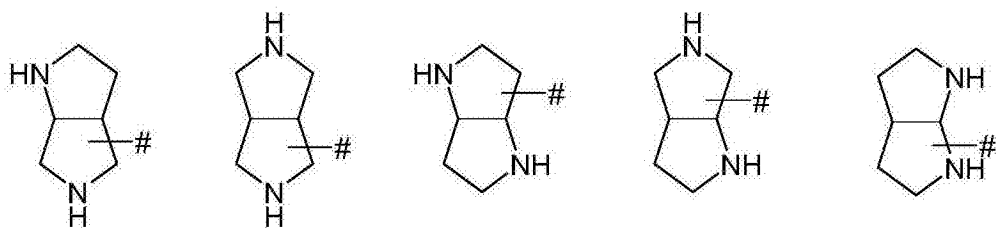
[0166] 3-、4-、5-、6-或7-元部分不饱和杂环的实例包括:2,3-二氢呋喃-2-基,2,3-二氢呋喃-3-基,2,4-二氢呋喃-2-基,2,4-二氢呋喃-3-基,2,3-二氢噻吩-2-基,2,3-二氢噻吩-3-基,2,4-二氢噻吩-2-基,2,4-二氢噻吩-3-基,2-吡咯啉-2-基,2-吡咯啉-3-基,3-吡咯啉-2-基,3-吡咯啉-3-基,2-异噁唑啉-3-基,3-异噁唑啉-3-基,4-异噁唑啉-3-基,2-异噁唑啉-4-基,3-异噁唑啉-4-基,4-异噁唑啉-4-基,2-异噁唑啉-5-基,3-异噁唑啉-5-基,4-异噁唑啉-5-基,2-异噻唑啉-3-基,3-异噻唑啉-3-基,4-异噻唑啉-3-基,2-异噻唑啉-4-基,3-异噻唑啉-4-基,4-异噻唑啉-4-基,2-异噻唑啉-5-基,3-异噻唑啉-5-基,4-异噻唑啉-5-基,2,3-二氢吡唑-1-基,2,3-二氢吡唑-2-基,2,3-二氢吡唑-3-基,2,3-二氢吡唑-4-基,2,3-二氢吡唑-5-基,3,4-二氢吡唑-1-基,3,4-二氢吡唑-3-基,3,4-二氢吡唑-4-基,3,4-二氢吡唑-5-基,4,5-二氢吡唑-1-基,4,5-二氢吡唑-3-基,4,5-二氢吡唑-4-基,4,5-二氢吡唑-5-基,2,3-二氢噁唑-2-基,2,3-二氢噁唑-3-基,2,3-二氢噁唑-4-基,2,3-二氢噁唑-5-基,3,4-二氢噁唑-2-基,3,4-二氢噁唑-3-基,3,4-二氢噁唑-4-基,3,4-二氢噁唑-5-基,3,4-二氢噁唑-2-基,3,4-二氢噁唑-3-基,3,4-二氢噁唑-4-基,2-,3-,4-,5-或6-二-或四氢吡啶基,3-二-或四氢哒嗪基,4-二-或四氢哒嗪基,2-二-或四氢嘧啶基,4-二-或四氢嘧啶基,5-二-或四氢嘧啶基,二-或四氢吡嗪基,1,3,5-二-或四氢三嗪-2-基,1,2,4-二-或四氢三嗪-3-基,2,3,4,5-四氢[1H]氮杂^草-1-、-2-、-3-、-4-、-5-、-6-或-7-基,3,4,5,6-四氢[2H]氮杂^草-2-、-3-、-4-、-5-、-6-或-7-基,2,3,4,7-四氢[1H]氮杂^草-1-、-2-、-3-、-4-、-5-、-6-或-7-基,2,3,6,7-四氢[1H]氮杂^草-1-、-2-、-3-、-4-、-5-、-6-或-7-基,四氢氧杂^草基,比如2,3,4,5-四氢[1H]氧杂^草-2-、-3-、-4-、-5-、-6-或-7-基,2,3,4,7-四氢[1H]氧杂^草-2-、-3-、-4-、-5-、-6-或-7-基,2,3,6,7-四氢[1H]氧杂^草-2-、-3-、-4-、-5-、-6-或-7-基,四氢-1,3-二氮杂^草基,四氢-1,4-二氮杂^草基,四氢-1,3-氧氮杂^草基,四氢-1,4-氧氮杂^草基,四氢-1,3-二氧杂^草基和四氢-1,4-二氧杂^草基。

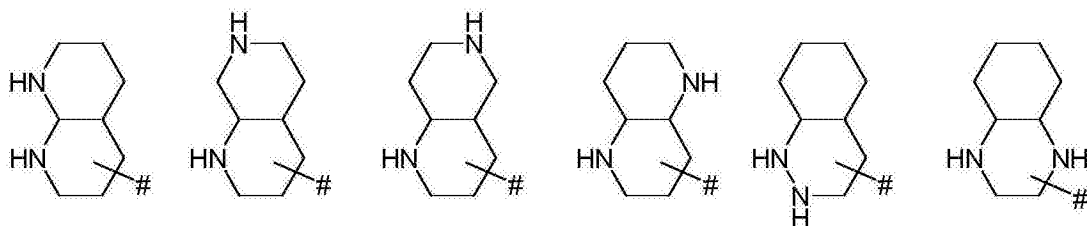
[0167] 3-、4-、5-、6-或7-元最大不饱和(包括芳族)杂环的实例是5-或6-元杂芳族环,比如2-呋喃基,3-呋喃基,2-噻吩基,3-噻吩基,1-吡咯基,2-吡咯基,3-吡咯基,1-吡唑基,3-吡唑基,4-吡唑基,5-吡唑基,2-噁唑基,4-噁唑基,5-噁唑基,2-噻唑基,4-噻唑基,5-噻唑基,1-咪唑基,2-咪唑基,4-咪唑基,1,3,4-三唑-1-基,1,3,4-三唑-2-基,2-吡啶基,3-吡啶基,4-吡啶基,1-氧代吡啶-2-基,1-氧代吡啶-3-基,1-氧代吡啶-4-基,3-哒嗪基,4-哒嗪基,2-嘧啶基,4-嘧啶基,5-嘧啶基和2-吡嗪基,以及同芳香性残基,比如1H-氮杂^草,1H-[1,3]-二氮杂^草和1H-[1,4]-二氮杂^草。

[0168] 8-、9-或10-元饱和杂双环环,其含有1、2或3(或4)个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员,的实例是:

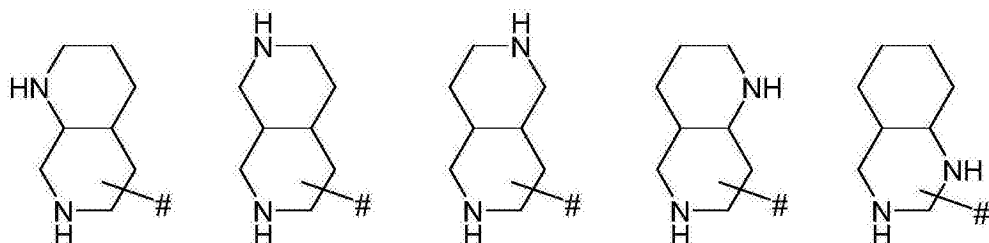


[0169]

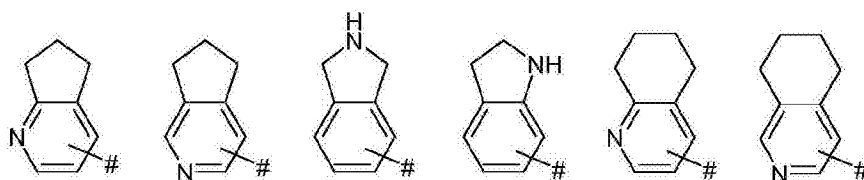




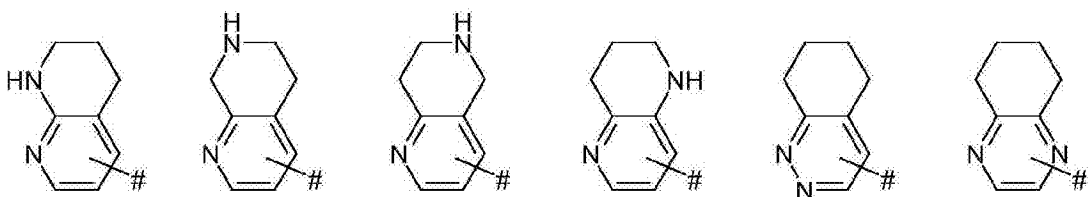
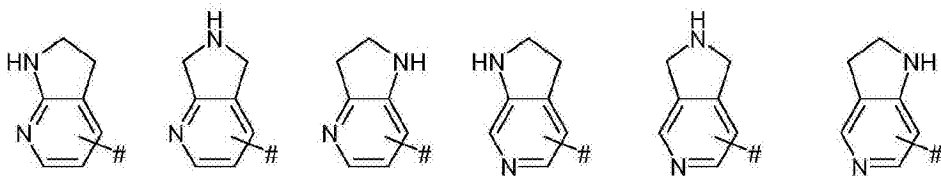
[0170]



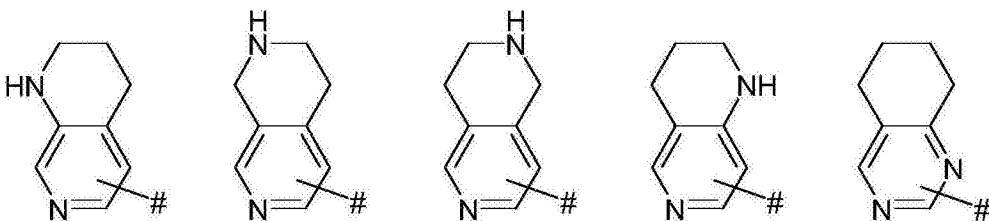
[0171] 8-、9-或10-元部分不饱和杂双环环,含有1、2或3(或4)个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员,的实例是:



[0172]

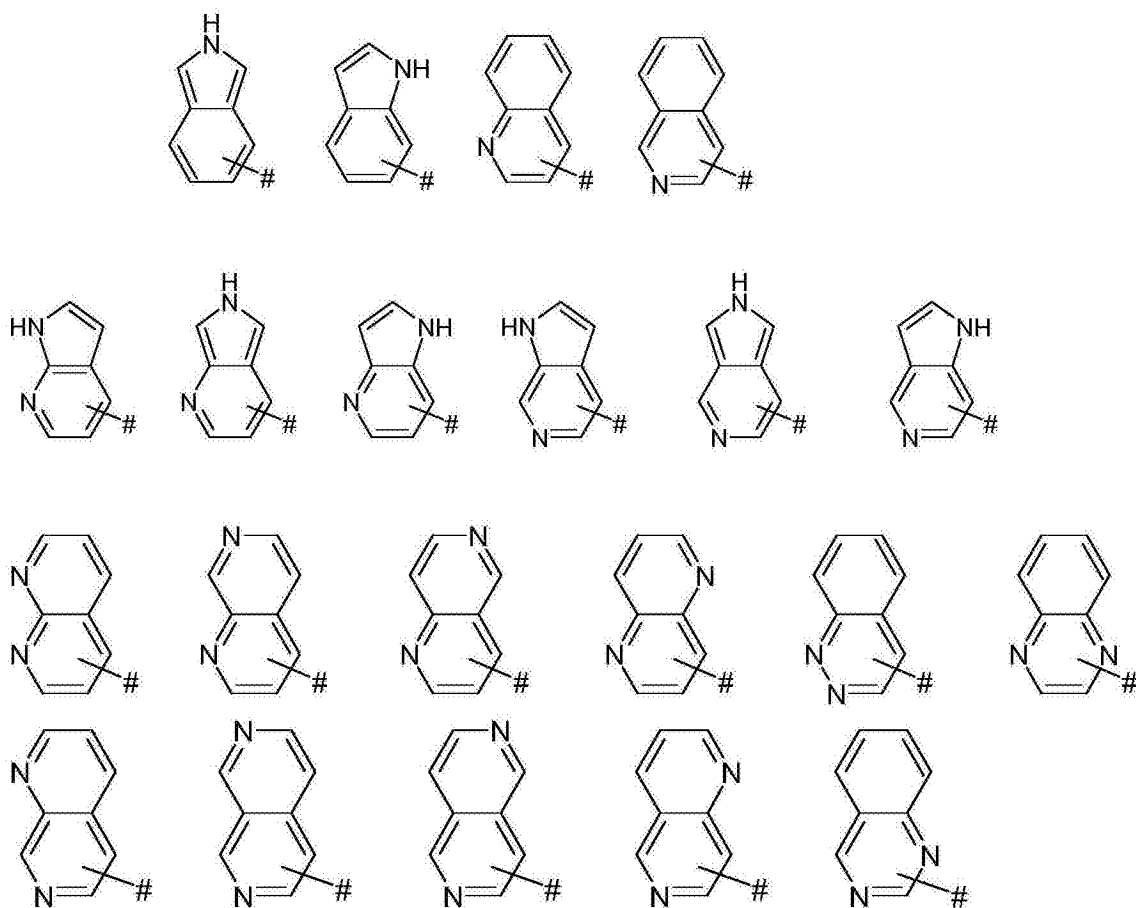


[0173]



[0174] 8-、9-或10-元最大不饱和的杂双环环,含有1、2或3(或4)个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员,的实例是:

[0175]



[0176] 在上述结构中,#表示与分子残余部分的连接点。连接点不限于其所显示的环上,而是能够在稠合的各环之一上,并且可以在碳或在氮环原子上。如果环携带一个或多个取代基,那么它们可以结合至碳和/或至氮环原子(如果后者不是双键的一部分)。

[0177] 饱和的3-、4-、5-、6-、7-、8-或9-元环,其中所述环可以含有1或2个选自O、S、N、 NR^{14} 、NO、SO和 SO_2 的杂原子或杂原子基团和/或1或2个选自 $\text{C}=\text{O}$ 、 $\text{C}=\text{S}$ 和 $\text{C}=\text{NR}^{14}$ 的基团作为环成员,是碳环或杂环。除了上述提及的饱和杂单环环之外,实例还是碳环,比如环丙基,环丙酮基,环丁基,环丁酮基,环戊基,环戊酮基,环己基,环己酮基,环己二烯酮基,环庚基,环庚烷酮基,环辛基,环辛酮基,呋喃-2-酮基,吡咯烷-2-酮基,吡咯烷-2,5-二酮基,哌啶-2-酮基,哌啶-2,6-二酮基等。

[0178] 涉及式I化合物变量的优选实施方式,特别是关于它们的取代基 A , A^1 , A^2 , A^3 , B^1 , B^2 , B^3 , G^1 , G^2 , R^1 , R^2 , R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} , R^4 , R^5 , R^{5a} , R^6 , R^{6a} , R^{6b} , R^{6c} , R^{7a} , R^{7b} , R^8 , R^9 , R^{10a} , R^{10b} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{14a} , R^{14b} , R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{18a} , R^{18b} , R^a , m 和 n ,根据本发明用途和方法特征和本发明组合物特征的下述描述不仅本身有效,并且尤其是可以相互进行每一种可能的组合。

[0179] 在本发明的一种实施方式中, A 是 A^1 。

[0180] 在一种优选实施方式中, A^1 是CN。

[0181] 在又一优选实施方式中, A^1 选自 $-\text{C}(=\text{NR}^6)\text{R}^8$ 和 $-\text{N}(\text{R}^5)\text{R}^6$ 和更优选是 $-\text{C}(=\text{NR}^6)\text{R}^8$;其中 R^5 , R^6 和 R^8 具有上述一般含义之一,或尤其是下述优选含义之一。

[0182] R^6 作为基团 $-\text{C}(=\text{NR}^6)\text{R}^8$ 中的残基优选选自氢,氰基, C_1 - C_{10} -烷基, C_3 - C_8 -环烷基, C_2 - C_{10} -烯基, C_2 - C_{10} -炔基,其中所提及的后4种脂族和环脂族残基各自独立地可以是部分或完全卤化的和/或可以被1、2、3、4、5或6个,优选1、2或3个,尤其是1个取代基 R^8 取代; $-\text{OR}^9$ 和-

$\text{NR}^{10a}\text{R}^{10b}$; 其中 $\text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10a}$ 和 R^{10b} 具有上述一般含义之一, 或尤其是下述优选含义之一。

[0183] 更优选, $-\text{C}(=\text{NR}^6)\text{R}^8$ 中的 R^6 选自氢, $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -烷基, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基, 其中所提及的后2种脂族和环脂族残基各自独立地可以是部分或完全卤化的和/或可以被1、2或3个, 优选1或2个, 尤其是1个取代基 R^8 取代; OR^9 和 $\text{NR}^{10a}\text{R}^{10b}$; 其中 $\text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10a}$ 和 R^{10b} 具有上述一般含义之一, 或尤其是下述优选含义之一。

[0184] 甚至更优选, $-\text{C}(=\text{NR}^6)\text{R}^8$ 中的 R^6 选自 OR^9 和 $\text{NR}^{10a}\text{R}^{10b}$; 其中 $\text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10a}$ 和 R^{10b} 具有上述一般含义之一, 或尤其是下述优选含义之一。

[0185] 在 OR^9 作为 $-\text{C}(=\text{NR}^6)\text{R}^8$ 中 R^6 的优选含义的情况下, R^9 优选选自氢, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -卤代环烷基, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -烯基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -卤代烯基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -炔基和 $\text{C}_2\text{-C}_6$ -卤代炔基, 和更优选氢, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -卤代环烷基和 $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-。

[0186] 在 $\text{NR}^{10a}\text{R}^{10b}$ 作为 $-\text{C}(=\text{NR}^6)\text{R}^8$ 中 R^6 的优选含义的情况下, R^{10a} 和 R^{10b} 相互独立地选自氢, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -烯基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -卤代烯基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -炔基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -卤代炔基, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -卤代环烷基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基羰基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基羰基, $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{15}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{14a})\text{R}^{14b}$, $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{14a})\text{R}^{14b}$, 苯基, 其任选被1、2、3或4个取代基 R^{16} 取代, 和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环, 包含1、2、3或4个选自N、O、S、NO、SO和 SO_2 的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环任选被一个或多个取代基 R^{16} 取代;

[0187] 或 R^{10a} 和 R^{10b} 与它们键合至的氮原子一起形成3-、4-、5-、6-、7-或8-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环, 其中所述杂环可以额外含有1个或2个选自N、O、S、NO、SO和 SO_2 的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环任选携带一个或多个取代基, 所述取代基选自卤素, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷氧基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷氧基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷硫基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷硫基, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -卤代环烷基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -烯基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -卤代烯基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -炔基和 $\text{C}_2\text{-C}_6$ -卤代炔基;

[0188] 其中 $\text{R}^{14a}, \text{R}^{14b}$ 和 R^{16} 具有上述一般含义之一, 或尤其是下述优选含义之一。

[0189] 更优选,

[0190] R^{10a} 选自氢, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基和 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基; 和

[0191] R^{10b} 选自 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基羰基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基羰基, $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{15}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{14a})\text{R}^{14b}$, $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{14a})\text{R}^{14b}$, 苯基, 其任选被1、2、3或4个取代基 R^{16} 取代, 和5-或6-元杂芳族环, 其包含1、2或3个选自N、O和S的杂原子作为环成员, 其中杂芳族环任选被一个或多个取代基 R^{16} 取代;

[0192] 其中 $\text{R}^{14a}, \text{R}^{14b}$ 和 R^{16} 具有上述一般含义之一, 或尤其是下述优选含义之一。

[0193] 甚至更优选,

[0194] R^{10a} 选自氢和 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基; 和

[0195] R^{10b} 选自 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{14a})\text{R}^{14b}$ 和 $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{14a})\text{R}^{14b}$; 和尤其是 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{14a})\text{R}^{14b}$;

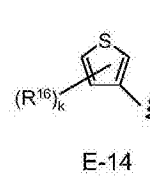
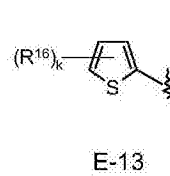
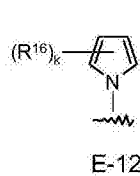
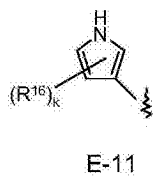
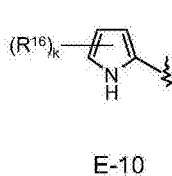
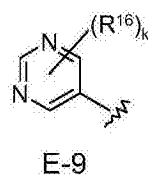
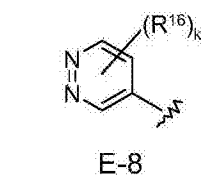
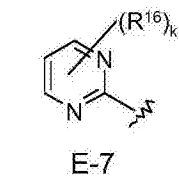
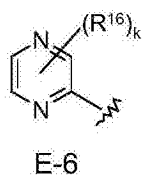
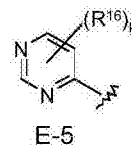
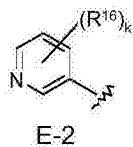
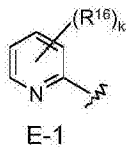
[0196] 其中 R^{14a} 和 R^{14b} 具有上述一般含义之一, 或尤其是下述优选含义之一。

[0197] 在上述残基 R^{10a} 和 R^{10b} 中,

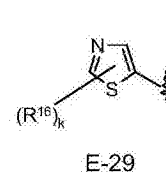
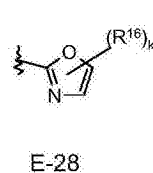
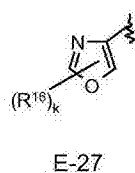
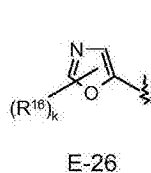
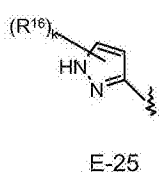
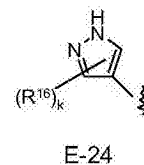
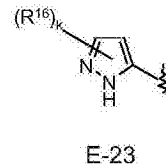
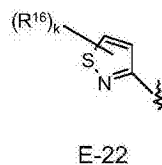
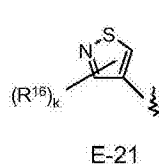
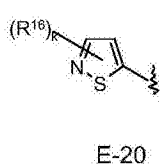
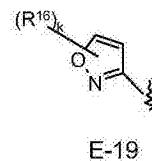
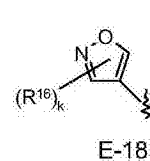
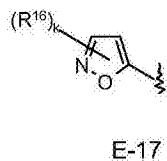
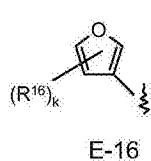
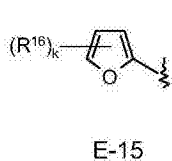
[0198] R^{14a} 选自氢, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基和 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基; 和

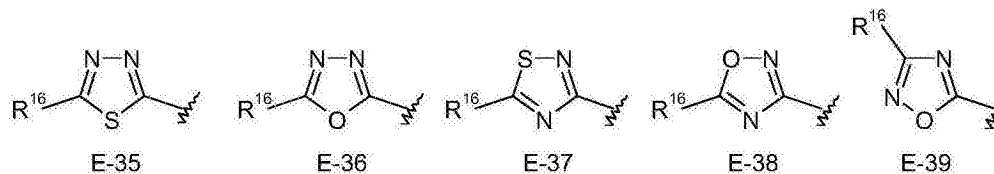
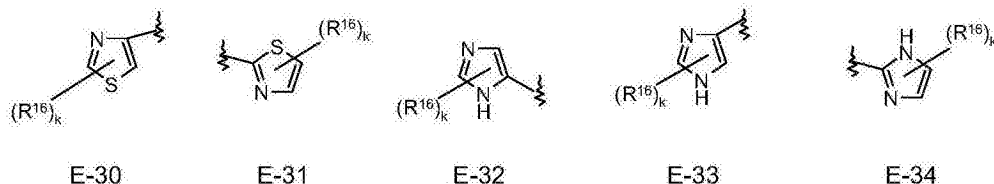
[0199] R^{14b} 选自氢, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -烯基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -卤代烯基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -炔基, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -卤代炔基, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -卤代环烷基, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-, 其中所

提及的后3种基团中的环烷基部分可以被氰基取代;被CN基团取代的C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-烷氧基, C₁-C₆-卤代烷氧基, 苯基, 其任选被1、2、3或4个取代基取代, 所述取代基各自独立选自卤素, 氰基, 硝基, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₁-C₄-烷氧基, C₁-C₄-卤代烷氧基, C₁-C₄-烷硫基, C₁-C₄-卤代烷硫基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基, C₂-C₄-烯基, C₂-C₄-卤代烯基, C₂-C₄-炔基和C₂-C₄-卤代炔基;和杂环, 选自式E-1至E-54、特别是E-1至E-51的环

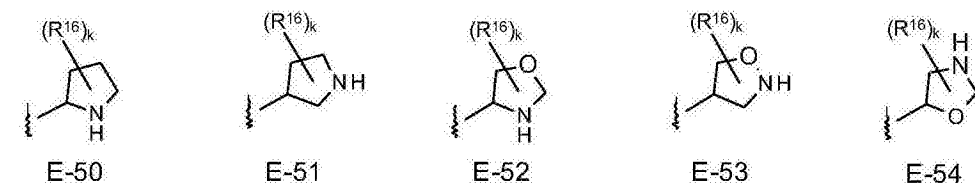
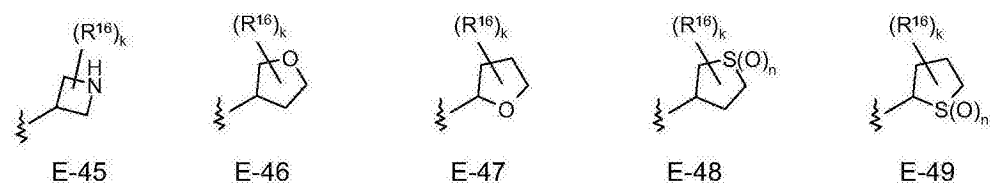
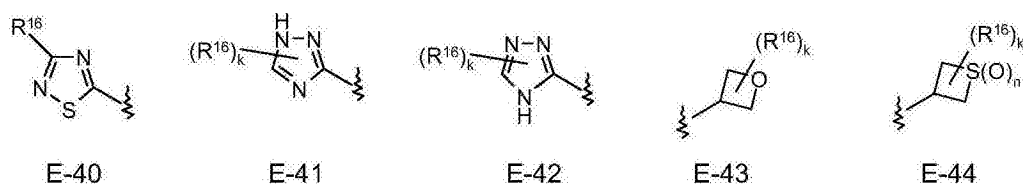


[0200]





[0201]



[0202] 其中

[0203] k 是0、1、2或3，[0204] n 是0、1或2；和

[0205] 各 R^{16} 独立选自卤素，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， C_1 - C_4 -烷硫基， C_1 - C_4 -卤代烷硫基， C_3 - C_6 -环烷基， C_3 - C_6 -卤代环烷基， C_2 - C_4 -烯基， C_2 - C_4 -卤代烯基， C_2 - C_4 -炔基和 C_2 - C_4 -卤代炔基；或

[0206] 饱和环的相同碳原子上存在的两个 R^{16} 可以一起形成 $=O$ 或 $=S$ 。

[0207] 更优选，在上述残基 R^{10a} 和 R^{10b} 中，

[0208] R^{14a} 选自氢和甲基；和

[0209] R^{14b} 选自氢， C_1 - C_4 -烷基， C_1 - C_4 -卤代烷基， C_2 - C_4 -烯基， C_2 - C_4 -卤代烯基， C_2 - C_4 -炔基， C_2 - C_4 -卤代炔基， C_3 - C_6 -环烷基， C_3 - C_6 -卤代环烷基， C_3 - C_6 -环烷基-甲基-，被CN基团取代的 C_3 - C_6 -环烷基，被CN基团取代的 C_1 - C_6 -烷基， C_1 - C_6 -烷氧基， C_1 - C_6 -卤代烷氧基，苯基，其任选被1、2、3或4个，优选1、2或3个，尤其是1个取代基 R^{16} 取代，所述取代基 R^{16} 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， C_1 - C_4 -烷硫基， C_1 - C_4 -

卤代烷硫基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基, C₂-C₄-烯基, C₂-C₄-卤代烯基, C₂-C₄-炔基和 C₂-C₄-卤代炔基; 和4-元饱和的杂环, 包含1个选自S、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员(环E-44), 其中所述杂环任选被一个或多个, 优选1或2个, 尤其是1个取代基R¹⁶取代;

[0210] 其中各R¹⁶独立选自卤素, 氰基, 硝基, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₁-C₄-烷氧基, C₁-C₄-卤代烷氧基, C₁-C₄-烷硫基, C₁-C₄-卤代烷硫基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基, C₂-C₄-烯基, C₂-C₄-卤代烯基, C₂-C₄-炔基和C₂-C₄-卤代炔基; 或

[0211] 在相同碳原子上存在的两个R¹⁶可以一起形成基团=O或=S。

[0212] 甚至更优选, 在上述残基R^{10a}和R^{10b}中,

[0213] R^{14a}选自氢和甲基; 和

[0214] R^{14b}选自氢, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₂-C₄-烯基, C₂-C₄-卤代烯基, C₂-C₄-炔基, C₂-C₄-卤代炔基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基, C₃-C₆-环烷基-甲基-, 被CN基团取代的C₃-C₆-环烷基, 被CN基团取代的C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-烷氧基和C₁-C₆-卤代烷氧基; 和尤其是选自氢, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₂-C₄-烯基, C₂-C₄-卤代烯基, C₂-C₄-炔基和C₂-C₄-卤代炔基。

[0215] 优选, 在上述残基中, 各R¹⁶独立选自卤素, CN, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷氧基。

[0216] R⁸作为基团-C(=NR⁶)R⁸中的残基优选选自氢, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基和NR^{10a}R^{10b}, 和更优选氢和NR^{10a}R^{10b}, 和特别是氢。

[0217] 在该情况下(也即NR^{10a}R^{10b}作为R⁸的含义), R^{10a}和R^{10b}优选相互独立地选自氢, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₂-C₄-烯基, C₂-C₄-卤代烯基, C₂-C₄-炔基, C₂-C₄-卤代炔基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基, C₁-C₄-烷基羰基, C₁-C₄-卤代烷基羰基, C₁-C₄-烷基氨基羰基, C₁-C₄-卤代烷基氨基羰基, C₃-C₆-环烷基氨基羰基和C₃-C₆-卤代环烷基氨基羰基,

[0218] 或与它们结合至的氮原子一起形成5-或6-元饱和、部分不饱和或芳族的杂环, 其额外地可以含有1或2个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的其它杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环可以携带1或2个, 尤其是1个取代基, 所述取代基选自卤素, CN, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₂-C₄-烯基, C₂-C₄-卤代烯基, C₂-C₄-炔基, C₂-C₄-卤代炔基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基, C₁-C₄-烷氧基, C₁-C₄-卤代烷氧基, C₁-C₄-烷硫基和C₁-C₄-卤代烷硫基。

[0219] 更优选, R^{10a}和R^{10b}在该情况下相互独立地选自氢, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基, C₁-C₄-烷基氨基羰基和C₁-C₄-卤代烷基氨基羰基。

[0220] 在本发明的各择实施方式中, A是A²。

[0221] 在A²中, W是优选O。

[0222] 在A²的一种优选实施方式中, R^{6a}是-X-R^{6b}, 其中X和R^{6b}具有上述一般含义之一, 或尤其是下述优选含义之一。

[0223] 优选, X选自-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(=O)-NH-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-C(=O)-NH-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂S(O)_n-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-S(O)_n-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-O-C(R^a)₂-, 和-C(R^a)₂-C(R^a)₂-O-C(R^a)₂-, 和更优选-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(=O)-NH-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-S(O)₂-C(R^a)₂-, 和-C(R^a)₂-C(R^a)₂-O-C(R^a)₂-, 其中各R^a和n具有上述一般含义之一, 或尤其是下述优选含义之一。

[0224] 优选, 各R^a独立选自氢和甲基和尤其是氢。

[0225] 优选,在上述基团X中,n是2。

[0226] 在其中 R^{6a} 是 $-X-R^{6b}$ 的上述基团 A^2 中, R^5 优选选自氢, C_1-C_6 -烷基, C_1-C_6 -卤代烷基, C_2-C_6 -烯基, C_2-C_6 -卤代烯基, C_2-C_6 -炔基, C_2-C_6 -卤代炔基, C_3-C_8 -环烷基和 C_3-C_8 -卤代环烷基,其中前述的脂族和环脂族残基可以被1、2或3个残基 R^8 取代;更优选氢, C_1-C_6 -烷基, C_1-C_6 -卤代烷基, C_2-C_6 -烯基, C_2-C_6 -卤代烯基, C_2-C_6 -炔基, C_2-C_6 -卤代炔基和 C_1-C_4 -烷基,其被下述取代:氰基, C_3-C_8 -环烷基或 C_1-C_4 -烷氧基;尤其是选自氢和 C_1-C_6 -烷基;和特别是氢;其中 R^8 具有上述一般含义之一,或尤其是下述优选含义之一。

[0227] 在该上下文中, R^8 优选选自氰基,任选由氰基取代的 C_3-C_8 -环烷基; C_3-C_8 -卤代环烷基, C_1-C_4 -烷氧基和 C_1-C_4 -卤代烷氧基,和更优选氰基, C_3-C_8 -环烷基和 C_1-C_4 -烷氧基。

[0228] 在其中 R^{6a} 是 $-X-R^{6b}$ 的上述基团 A^2 中, R^{6b} 优选选自 C_2-C_8 -烯基, C_2-C_8 -卤代烯基, C_2-C_8 -炔基, C_2-C_8 -卤代炔基, C_3-C_8 -环烷基, C_3-C_8 -卤代环烷基和被氰基取代的 C_3-C_8 -环烷基。

[0229] 在 A^2 的又一优选实施方式中, R^{6a} 是 $-N(R^{5a})R^{6c}$,其中 R^{5a} 和 R^{6c} 具有上述一般含义之一,或尤其是下述优选含义之一。

[0230] 在其中 R^{6a} 是 $N(R^{5a})R^{6c}$ 的上述基团 A^2 中, R^{5a} 优选选自氢, C_1-C_6 -烷基, C_1-C_6 -卤代烷基, C_2-C_6 -烯基, C_2-C_6 -卤代烯基, C_2-C_6 -炔基, C_2-C_6 -卤代炔基, C_3-C_8 -环烷基和 C_3-C_8 -卤代环烷基,其中前述的脂族和环脂族残基可以被1、2或3个残基 R^8 取代;优选氢, C_1-C_6 -烷基, C_1-C_6 -卤代烷基, C_2-C_6 -烯基, C_2-C_6 -卤代烯基, C_2-C_6 -炔基, C_2-C_6 -卤代炔基和 C_1-C_4 -烷基,其被下述取代:氰基, C_3-C_8 -环烷基或 C_1-C_4 -烷氧基,尤其是选自氢和 C_1-C_6 -烷基;和特别是氢;

[0231] 其中 R^8 具有上述一般含义之一,或尤其是下述优选含义之一。

[0232] 在其中 R^{6a} 是 $N(R^{5a})R^{6c}$ 的上述基团 A^2 中, R^5 优选选自氢, C_1-C_6 -烷基, C_1-C_6 -卤代烷基, C_2-C_6 -烯基, C_2-C_6 -卤代烯基, C_2-C_6 -炔基, C_2-C_6 -卤代炔基, C_3-C_8 -环烷基和 C_3-C_8 -卤代环烷基,其中前述的脂族和环脂族残基可以被1、2或3个残基 R^8 取代;优选氢, C_1-C_6 -烷基, C_1-C_6 -卤代烷基, C_2-C_6 -烯基, C_2-C_6 -卤代烯基, C_2-C_6 -炔基, C_2-C_6 -卤代炔基和 C_1-C_4 -烷基,其被下述取代:氰基, C_3-C_8 -环烷基或 C_1-C_4 -烷氧基,尤其是选自氢和 C_1-C_6 -烷基;和特别是氢;

[0233] 其中 R^8 具有上述一般含义之一,或尤其是下述优选含义之一。

[0234] 在该上下文中, R^8 优选选自氰基,任选由氰基取代的 C_3-C_8 -环烷基; C_3-C_8 -卤代环烷基, C_1-C_4 -烷氧基和 C_1-C_4 -卤代烷氧基,和更优选氰基, C_3-C_8 -环烷基和 C_1-C_4 -烷氧基。

[0235] 在其中 R^{6a} 是 $N(R^{5a})R^{6c}$ 的上述基团 A^2 中, R^{6c} 优选选自 $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$ 和 $-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$,和尤其是选自 $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$,其中 R^{14a} 和 R^{14b} 具有上述一般含义之一,或尤其是下述优选含义之一。

[0236] 优选,在上述残基 $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$ 和 $-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$ 中,

[0237] R^{14a} 选自氢, C_1-C_6 -烷基和 C_1-C_6 -卤代烷基;和

[0238] R^{14b} 选自氢, C_1-C_6 -烷基, C_1-C_6 -卤代烷基, C_2-C_6 -烯基, C_2-C_6 -卤代烯基, C_2-C_6 -炔基, C_2-C_6 -卤代炔基, C_3-C_6 -环烷基, C_3-C_6 -卤代环烷基, C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_4 -烷基-,其中所提及的后3种基团中的环烷基部分可以被氰基取代;被CN基团取代的 C_1-C_6 -烷基, C_1-C_6 -烷氧基, C_1-C_6 -卤代烷氧基,苯基,其任选被1、2、3或4个取代基取代,所述取代基各自独立选自卤素,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, C_1-C_4 -烷硫基, C_1-C_4 -卤代烷硫基, C_3-C_6 -环烷基, C_3-C_6 -卤代环烷基, C_2-C_4 -烯基, C_2-C_4 -卤代烯基, C_2-C_4 -炔基和 C_2-C_4 -卤代炔基;和杂环,选自如前文所定义的式E-1至E-54、特别是E-1至E-51的

环。

[0239] 更优选,在上述残基 $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$ 和 $-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$ 中,

[0240] R^{14a} 选自氢和甲基;和

[0241] R^{14b} 选自氢, C_1-C_6 -烷基, C_1-C_6 -卤代烷基, C_2-C_6 -烯基, C_2-C_6 -卤代烯基, C_2-C_6 -炔基, C_2-C_6 -卤代炔基, C_3-C_6 -环烷基, C_3-C_6 -卤代环烷基, C_3-C_6 -环烷基-甲基-, 被CN基团取代的 C_3-C_6 -环烷基, 被CN基团取代的 C_1-C_6 -烷基, C_1-C_6 -烷氧基, C_1-C_6 -卤代烷氧基, 苯基, 其任选被1、2、3或4个, 优选1、2或3个, 尤其是1个取代基 R^{16} 取代, 所述取代基 R^{16} 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, C_1-C_4 -烷硫基, C_1-C_4 -卤代烷硫基, C_3-C_6 -环烷基, C_3-C_6 -卤代环烷基, C_2-C_4 -烯基, C_2-C_4 -卤代烯基, C_2-C_4 -炔基和 C_2-C_4 -卤代炔基; 和4-元饱和杂环, 包含1个选自S、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员(环E-44), 其中所述杂环任选被一个或多个, 优选1或2个, 尤其是1个取代基 R^{16} 取代;

[0242] 其中各 R^{16} 独立选自卤素, 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, C_1-C_4 -烷硫基, C_1-C_4 -卤代烷硫基, C_3-C_6 -环烷基, C_3-C_6 -卤代环烷基, C_2-C_4 -烯基, C_2-C_4 -卤代烯基, C_2-C_4 -炔基和 C_2-C_4 -卤代炔基; 或

[0243] 相同碳原子上存在的两个 R^{16} 可以一起形成基团 $=O$ 或 $=S$ 。

[0244] 甚至更优选,在上述残基 $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$ 和 $-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$ 中,

[0245] R^{14a} 选自氢和 C_1-C_6 -烷基, 尤其是选自氢和甲基; 和

[0246] R^{14b} 选自氢, C_1-C_6 -烷基, C_1-C_6 -卤代烷基, C_2-C_6 -烯基, C_2-C_6 -卤代烯基, C_2-C_6 -炔基, C_2-C_6 -卤代炔基, C_3-C_6 -环烷基, C_3-C_6 -卤代环烷基, C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_4 -烷基-, 其中所提及的后3种基团中的环烷基部分可以被氰基取代; 和被CN基团取代的 C_1-C_6 -烷基。

[0247] 特别,在上述残基 $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$ 和 $-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$ 中,

[0248] R^{14a} 是氢; 和

[0249] R^{14b} 选自氢, C_1-C_4 -烷基, C_1-C_4 -卤代烷基, C_2-C_4 -烯基, C_2-C_4 -卤代烯基, C_2-C_4 -炔基, C_2-C_4 -卤代炔基, C_3-C_6 -环烷基, C_3-C_6 -卤代环烷基, C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_4 -烷基-, 其中所提及的后3种基团中的环烷基部分可以被氰基取代; 和被CN基团取代的 C_1-C_6 -烷基; 和尤其是选自氢, C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -卤代烷基。

[0250] 优选,在上述残基中,各 R^{16} 独立选自卤素, CN, 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。

[0251] 在A²的又一优选实施方式中, A²中的R⁵是氢和R^{6a}选自氢, 1-氰基环丙基, 1-氰基环丁基和1-氰基环戊基; 或,

[0252] R⁵和R^{6a}一起形成基团 $=S(O)_m(R^9)_2$, 其中R⁹和m具有上述一般含义之一, 或尤其是下述优选含义之一。

[0253] 在该上下文中, R⁹选自 C_1-C_6 -烷基, C_1-C_6 -卤代烷基, C_3-C_8 -环烷基, C_3-C_8 -环烷基- C_1-C_4 -烷基-, C_3-C_8 -卤代环烷基, C_2-C_6 -烯基, C_2-C_6 -卤代烯基, C_2-C_6 -炔基, C_2-C_6 -卤代炔基, 苯基和苄基, 其中所提及的后2种基团中的苯基部分可以携带1、2、3、4或5个, 优选1、2或3个, 尤其是1个残基 R^{16} , 更优选 C_1-C_6 -烷基和 C_1-C_6 -卤代烷基, 和尤其是 C_1-C_6 -烷基;

[0254] 其中R¹⁶具有上述一般含义之一, 或尤其是下述优选含义之一。

[0255] 优选,在上述残基中,各 R^{16} 独立选自卤素, CN, 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。

[0256] 在A²的特别实施方式中,A²中的R⁵是氢和R^{6a}选自氢和1-氰基环丙基。

[0257] 在本发明的备择实施方式中,A是A³。

[0258] 优选,基团A³中的R^{7a}和R^{7b}相互独立选自氢,氰基,C₁-C₄-烷基和C₁-C₄-卤代烷基,和更优选氢,C₁-C₄-烷基和C₁-C₄-卤代烷基。甚至更优选,R^{7a}和R^{7b}之一是氢而另一个是氢或甲基。特别,均是氢。

[0259] 在基团A³中,

[0260] R⁵优选选自氢,C₁-C₆-烷基,C₃-C₆-环烷基,C₂-C₆-烯基,C₂-C₆-炔基,其中所提及的后4种脂族和环脂族残基可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个,优选1、2或3个,尤其是1个取代基R⁸取代;和

[0261] R⁶优选选自氢,C₁-C₆-烷基,C₃-C₆-环烷基,C₂-C₆-烯基,C₂-C₆-炔基,其中所提及的后4种脂族和环脂族残基可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个,优选1、2或3个,尤其是1个取代基R⁸取代,

[0262] -OR⁹, -NR^{10a}R^{10b}, -S(O)_nR⁹, -C(=O)NR^{10a}N(R^{10a}R^{10b}), -C(=O)R⁸,

[0263] 和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂单环或杂双环环,含有1、2、3或4个独立选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员,其中所述杂单环或杂双环环可以被一个或多个,优选1、2或3个,尤其是1个取代基R¹¹取代;

[0264] 或

[0265] R⁵和R⁶与它们结合至的氮原子一起形成3-、4-、5-或6-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环,其中所述环可以还含有1、2、3或4个选自O、S、N、SO、SO₂、C=O和C=S的杂原子或含杂原子基团作为环成员,其中所述杂环可以被1、2、3、4或5个,优选1、2或3个,尤其是1个取代基取代,所述取代基独立选自卤素,氰基,C₁-C₆-烷基,C₁-C₆-卤代烷基,C₁-C₆-烷氧基,C₁-C₆-卤代烷氧基,C₁-C₆-烷硫基,C₁-C₆-卤代烷硫基,C₃-C₈-环烷基,C₃-C₈-卤代环烷基,C₂-C₆-烯基,C₂-C₆-卤代烯基,C₂-C₆-炔基,C₂-C₆-卤代炔基,其中所提及的后12种残基中的脂族或环脂族部分可以被一个或多个,优选1、2或3个,尤其是1个残基R⁸取代,和苯基,其可以被1、2、3、4或5个,优选1、2或3个,尤其是1个取代基R¹¹取代;

[0266] 其中R⁸,R⁹,R^{10a},R^{10b}和R¹¹具有上述一般含义之一,或尤其是下述优选含义之一。

[0267] 更优选,在基团A³中,

[0268] R⁵选自氢,C₁-C₄-烷基,C₁-C₄-卤代烷基,C₂-C₃-烯基,C₂-C₃-炔基,-CH₂-CN和C₁-C₆-烷氧基-甲基-和优选氢和C₁-C₄-烷基;和

[0269] R⁶是-C(=O)R⁸;

[0270] 其中R⁸具有上述一般含义之一,或尤其是下述优选含义之一。

[0271] -C(=O)R⁸中的R⁸,作为基团A³残基R⁵和R⁶的含义,优选选自氢,氰基,C₁-C₆-烷基,C₁-C₆-卤代烷基,C₂-C₃-烯基,C₂-C₃-卤代烯基,C₂-C₃-炔基,C₂-C₃-卤代炔基,C₃-C₈-环烷基,C₃-C₈-卤代环烷基,C₃-C₈-环烯基,C₃-C₈-卤代环烯基,其中所提及的后10种残基中的脂族和环脂族部分可以被一个或多个,优选1、2或3个,尤其是1个残基R¹³取代;

[0272] -OR⁹, -S(O)_nR⁹, -N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b},

[0273] 苯基,任选被1、2、3、4或5个,优选1、2或3个,尤其是1个取代基R¹⁶取代,和3-、4-、5-或6-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环,包含1、2或3个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员,其中所述杂环任选被一个或多个,优选1、2或3个,尤其是1

个取代基 R^{16} 取代,

[0274] 其中 $n, R^9, R^{10a}, R^{10b}, R^{13}$ 和 R^{16} 具有上述一般含义之一,或尤其是下述优选含义之一。

[0275] 更优选, $-C(=O)R^8$ 中的 R^8 ,作为基团 A^3 残基 R^5 和 R^6 的含义,选自 C_1 - C_6 -烷基, C_1 - C_6 -卤代烷基, C_2 - C_3 -烯基, C_2 - C_3 -卤代烯基, C_2 - C_3 -炔基, C_2 - C_3 -卤代炔基, C_3 - C_8 -环烷基, C_3 - C_8 -卤代环烷基, C_3 - C_8 -环烯基, C_3 - C_8 -卤代环烯基,其中所提及的后10种残基中的脂族和环脂族部分可以被一个或多个,优选1、2或3个,尤其是1个残基 R^{13} 取代;

[0276] $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$, $-N(R^{10a})R^{10b}$, 苯基,其任选被1、2、3、4或5个,优选1、2或3个,尤其是1个取代基取代,所述取代基各自独立选自卤素,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, C_1 - C_4 -烷硫基, C_1 - C_4 -卤代烷硫基, C_3 - C_6 -环烷基, C_3 - C_6 -卤代环烷基, C_2 - C_4 -烯基, C_2 - C_4 -卤代烯基, C_2 - C_4 -炔基和 C_2 - C_4 -卤代炔基;和杂环,选自如前文所定义的式E-1至E-54、特别是E-1至E-51的环。

[0277] 尤其是, $-C(=O)R^8$ 中的 R^8 ,作为基团 A^3 残基 R^5 和 R^6 的含义,选自 C_1 - C_6 -烷基, C_1 - C_6 -卤代烷基, C_1 - C_6 -烷基,其携带残基 R^{13} , C_3 - C_8 -环烷基和 C_3 - C_8 -卤代环烷基。

[0278] $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$ 和 $-N(R^{10a})R^{10b}$ 中的 R^{10a} 和 R^{10b} ,作为基团 $-C(=O)R^8$ 中 R^8 的含义、基团 $-C(=O)R^8$ 又作为基团 A^3 残基 R^5 和 R^6 的含义,相互独立地优选选自氢, C_1 - C_6 -烷基, C_1 - C_6 -卤代烷基, C_2 - C_3 -烯基, C_2 - C_3 -卤代烯基, C_2 - C_3 -炔基, C_2 - C_3 -卤代炔基, C_3 - C_8 -环烷基, C_3 - C_8 -卤代环烷基,其中所提及的后8种残基中的脂族和环脂族部分可以被一个或多个残基 R^{13} 取代;和 $-C(=O)NR(^{14a})R^{14b}$ 。

[0279] 基团 A^3 残基 R^5 和 R^6 中的 R^8 中的 R^{13} 优选选自CN, C_1 - C_6 -烷氧基, C_1 - C_6 -卤代烷氧基, C_1 - C_6 -烷硫基, C_1 - C_6 -卤代烷硫基, C_1 - C_6 -烷基亚磺酰基, C_1 - C_6 -卤代烷基亚磺酰基, C_1 - C_6 -烷基磺酰基, C_1 - C_6 -卤代烷基磺酰基, $NR(^{14a})R^{14b}$,和杂环,选自如前文所定义的式E-1至E-54、特别是E-1至E-51的环;或烷基的相同碳原子上存在的两个 R^{13} 可以一起是 $=NOR^{17}$;和优选选自 C_1 - C_6 -烷氧基, C_1 - C_6 -卤代烷氧基, C_1 - C_6 -烷硫基, C_1 - C_6 -卤代烷硫基, C_1 - C_6 -烷基磺酰基和 C_1 - C_6 -卤代烷基磺酰基;和尤其是 C_1 - C_6 -烷基磺酰基或 C_1 - C_6 -卤代烷基磺酰基。

[0280] $-C(=O)NR(^{14a})R^{14b}$ 中的 R^{14a} 和 R^{14b} ,作为 R^{10a} 和 R^{10b} 的含义,以及 $NR(^{14a})R^{14b}$ 中的 R^{14a} 和 R^{14b} ,作为 R^{13} 的含义,相互独立且各次出现独立地优选选自氢, C_1 - C_6 -烷基, C_1 - C_6 -卤代烷基, C_2 - C_6 -烯基, C_2 - C_6 -卤代烯基, C_2 - C_6 -炔基, C_2 - C_6 -卤代炔基,其中所提及的后6种脂族残基可以携带1个取代基,所述取代基选自氰基, C_1 - C_4 -烷氧基, C_1 - C_4 -卤代烷氧基, C_3 - C_4 -环烷基,其可以被1个氰基取代;和 C_3 - C_4 -卤代环烷基;

[0281] C_3 - C_8 -环烷基,其可以携带1个氰基; C_3 - C_8 -卤代环烷基;和 $-C(=O)NR^{18a}R^{18b}$ 。

[0282] 优选,各 R^{16} 作为式E-1至E-54苯基或杂环上的取代基独立选自卤素,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, C_1 - C_4 -烷硫基, C_1 - C_4 -卤代烷硫基, C_3 - C_6 -环烷基, C_3 - C_6 -卤代环烷基, C_2 - C_4 -烯基, C_2 - C_4 -卤代烯基, C_2 - C_4 -炔基和 C_2 - C_4 -卤代炔基;或

[0283] 饱和杂环的相同碳原子上存在的两个 R^{16} 可以一起形成 $=O$ 或 $=S$ 。

[0284] $=NOR^{17}$ 中的 R^{17} ,作为 R^{13} 的含义; $-C(=O)NR^{18a}R^{18b}$ 中的 R^{18a} 和 R^{18b} ,作为 R^{14a} 和 R^{14b} 的含义,相互独立且各次出现独立地优选选自氢, C_1 - C_6 -烷基, C_1 - C_6 -卤代烷基, C_2 - C_6 -烯基, C_2 - C_6 -卤代烯基, C_2 - C_6 -炔基, C_2 - C_6 -卤代炔基, C_1 - C_6 -烷基,其携带1个取代基,所述取代基选自氰基, C_3 - C_4 -环烷基,其可以被1个氰基取代;和 C_3 - C_4 -卤代环烷基; C_3 - C_8 -环烷基,其可以

携带1个氰基;和C₃-C₈-卤代环烷基。

[0285] 优选, B¹, B²和B³是CR²。

[0286] 优选, R²选自氢, 卤素, 氰基, 叠氮基, 硝基, -SCN, -SF₅, C₁-C₆-烷基, C₃-C₈-环烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-炔基, 其中所提及的后4种脂族和环脂族残基可以是部分或完全卤化的和/或可以被一个或多个残基R⁸取代, -OR⁹, -S(O)_nR⁹和-NR^{10a}R^{10b}, 其中n, R⁸, R⁹, R^{10a}和R^{10b}具有上述一般含义之一, 或尤其是下述优选含义之一。

[0287] 更优选, R²选自氢, 卤素和C₁-C₂-卤代烷基, 甚至更优选氢, F, Cl, Br和CF₃, 甚至更优选氢, F, Cl和CF₃, 和特别选自氢, F和Cl。

[0288] 特别, B¹和B³是C-Cl和B²是C-F或C-Cl。

[0289] 优选, G¹和G²是CR⁴, 其中R⁴具有上述一般含义之一, 或尤其是下述优选含义之一。

[0290] 优选, R⁴选自氢, 卤素, 氰基, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₃-C₅-环烷基, C₃-C₅-卤代环烷基, C₂-C₄-烯基, C₂-C₄-卤代烯基, C₂-C₄-炔基, C₂-C₄-卤代炔基, C₁-C₄-烷氧基, C₁-C₄-卤代烷氧基, C₁-C₄-烷硫基和C₁-C₄-卤代烷硫基, 和尤其是氢。

[0291] 优选, R¹选自C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷氧基-C₁-C₄-烷基, C₃-C₆-环烷基C₃-C₆-卤代环烷基或C(=O)OR¹³;更优选选自C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基和C(=O)OR¹⁵, 甚至更优选C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基和-C(=O)OR¹⁵, 和特别优选C₁-C₄-卤代烷基和-C(=O)OR¹⁵, 其中R¹⁵优选是C₁-C₄-烷基。尤其是, R¹是C₁-C₄-卤代烷基, 特别是C₁-C₂-卤代烷基和更特别是卤代甲基, 尤其是氟甲基比如氟甲基、二氟甲基和三氟甲基, 和很特别是三氟甲基。

[0292] 优选, R^{3a}和R^{3b}相互独立地选自氢, 卤素, 羟基, C₁-C₃-烷基, C₁-C₃-烯基, C₁-C₃-炔基, C₁-C₃-卤代烷基, C₁-C₃-烷氧基, C₁-C₃-烷硫基和C₁-C₃-烷基磺酰基, 更优选氢和卤素, 尤其是选自氢和氟和特别是氢。

[0293] 如果上文没有另外指定, R⁸, R⁹, R^{10a}, R^{10b}, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R^{18a}和R^{18b}具有下述优选的含义:

[0294] 在R⁸是烷基、烯基或炔基上的取代基的情况下, 其优选选自氰基, C₃-C₈-环烷基, C₃-C₈-卤代环烷基, -OR⁹, -SR⁹, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=S)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)OR⁹, 苯基, 其可以被1、2、3、4或5个残基R¹⁶取代, 和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或芳族的杂环, 含有1、2或3个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环可以被一个或多个残基R¹⁶取代; 其中R⁹, R^{10a}, R^{10b}和R¹⁶具有上述含义之一, 或尤其是下述优选含义之一。

[0295] 在R⁸是烷基、烯基或炔基上的取代基的情况下, 其甚至更优选选自氰基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基, C₁-C₄-烷氧基, C₁-C₄-卤代烷氧基, C₁-C₄-烷硫基, C₁-C₄-卤代烷硫基, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=S)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)OR⁹, 苯基, 其可以被1、2、3、4或5个残基R¹⁶取代, 和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或芳族的杂环, 含有1、2或3个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环可以被一个或多个残基R¹⁶取代; 其中R⁹, R^{10a}, R^{10b}和R¹⁶具有上述含义之一, 或尤其是下述优选含义之一。尤其是, 其选自氰基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=S)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)OR⁹, 苯基, 其可以被1、2、3、4或5个残基R¹⁶取代, 和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或芳族的杂环, 含有1、2或3个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其

中所述杂环可以被一个或多个残基 R^{16} 取代;其中 R^9 , R^{10a} , R^{10b} 和 R^{16} 具有上述含义之一,或尤其是下述优选含义之一。

[0296] 在 R^8 是环烷基上的取代基的情况下,其优选选自氰基, C_1 - C_6 -烷基, C_1 - C_6 -卤代烷基, C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_6 -烷基, $-OR^9$, $-OSO_2R^9$, $-SR^9$, $-N(R^{10a})R^{10b}$, $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$, $-C(=S)N(R^{10a})R^{10b}$, $-C(=O)OR^9$, 苯基,其可以被1、2、3、4或5个残基 R^{16} 取代,和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或芳族的杂环,含有1、2或3个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员,其中所述杂环可以被一个或多个残基 R^{16} 取代;其中 R^9 , R^{10a} , R^{10b} 和 R^{16} 具有上述含义之一,或尤其是下述优选含义之一。

[0297] 在 R^8 是环烷基上的取代基的情况下,其甚至更优选选自氰基, C_1 - C_4 -烷基, C_1 - C_3 -卤代烷基, C_1 - C_4 -烷氧基和 C_1 - C_3 -卤代烷氧基。尤其是, R^8 作为环烷基上的取代基选自氰基, C_1 - C_4 -烷基和 C_1 - C_3 -卤代烷基。

[0298] 在 R^8 于基团 $-C(=O)R^8$, $=C(R^8)_2$ 或 $-C(=NR^6)R^8$ 的情况下, R^8 优选选自氢, C_1 - C_6 -烷基, C_1 - C_6 -卤代烷基, C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_6 -烷基, C_3 - C_8 -环烷基, C_3 - C_8 -卤代环烷基, C_2 - C_6 -烯基, C_2 - C_6 -卤代烯基, C_2 - C_6 -炔基, C_2 - C_6 -卤代炔基, $-OR^9$, $-SR^9$, $-N(R^{10a})R^{10b}$, 苯基,其可以被1、2、3、4或5个残基 R^{16} 取代,和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或芳族的杂环,含有1、2或3个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员,其中所述杂环可以被一个或多个残基 R^{16} 取代;其中 R^9 , R^{10a} , R^{10b} 和 R^{16} 具有上述含义之一,或尤其是下述优选含义之一。

[0299] 在 R^8 于基团 $-C(=O)R^8$, $=C(R^8)_2$ 或 $-C(=NR^6)R^8$ 的情况下, R^8 更优选选自 C_1 - C_6 -烷基, C_1 - C_6 -卤代烷基, C_3 - C_8 -环烷基, C_3 - C_8 -卤代环烷基, C_1 - C_6 -烷氧基, C_1 - C_6 -卤代烷氧基, $-N(R^{10a})R^{10b}$, 苯基,其可以被1、2、3、4或5个残基 R^{16} 取代,和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或芳族的杂环,含有1、2或3个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员,其中所述杂环可以被一个或多个残基 R^{16} 取代;其中 R^{10a} , R^{10b} 和 R^{16} 具有上述含义之一,或尤其是下述优选含义之一。

[0300] 优选,各 R^9 独立选自氢, C_1 - C_6 -烷基, C_1 - C_6 -卤代烷基, C_3 - C_8 -环烷基, C_3 - C_8 -卤代环烷基, C_3 - C_8 -环烷基- C_1 - C_4 -烷基, 苯基,其可以被1、2、3、4或5个残基 R^{16} 取代;和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或芳族的杂环,含有1、2或3选自N、O、S、NO、SO和SO₂的个杂原子或杂原子基团作为环成员,其中所述杂环可以被一个或多个,例如1、2、3或4个,优选1或2个,更优选1个残基 R^{16} 取代,其中 R^{16} 具有上述含义之一,或尤其是下述优选含义之一。

[0301] 更优选,各 R^9 独立选自氢, C_1 - C_6 -烷基, C_1 - C_6 -卤代烷基, 苯基,其可以被1、2、3、4或5个残基 R^{16} 取代;和5-或6-元杂芳族环,含有1、2或3个选自N、O和S的杂原子作为环成员,其中所述杂芳族环可以被一个或多个残基 R^{16} 取代;其中 R^{16} 具有上述含义之一,或尤其是下述优选含义之一。

[0302] R^{10a} 和 R^{10b} 相互独立地优选选自氢, C_1 - C_4 -烷基, C_1 - C_4 -卤代烷基, C_2 - C_4 -烯基, C_2 - C_4 -卤代烯基, C_2 - C_4 -炔基, C_2 - C_4 -卤代炔基, C_3 - C_6 -环烷基, C_3 - C_6 -卤代环烷基, C_1 - C_4 -烷基羰基, C_1 - C_4 -卤代烷基羰基, C_1 - C_4 -烷基氨基羰基, C_1 - C_4 -卤代烷基氨基羰基, C_3 - C_6 -环烷基氨基羰基, C_3 - C_6 -卤代环烷基氨基羰基,和3-、4-、5-、6-或7-元饱和、部分不饱和或最大不饱和的杂环,包含1、2或3个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员,其中所述杂环任选用一个或多个,优选1、2或3个,尤其是1个取代基取代,所述取代基选自卤素, CN, C_1 - C_4 -烷基, C_1 - C_4 -卤代烷基, C_2 - C_4 -烯基, C_2 - C_4 -卤代烯基, C_2 - C_4 -炔基, C_2 - C_4 -卤代炔基, C_3 - C_6 -

环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基, C₁-C₄-烷氧基, C₁-C₄-卤代烷氧基, C₁-C₄-烷硫基和C₁-C₄-卤代烷硫基;

[0303] 或者, R^{10a}和R^{10b}与它们结合至的氮原子一起形成5-或6-元饱和、部分不饱和或芳族的杂环, 其额外地可以含有1或2个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的其它杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环可以携带1或2个, 尤其是1个取代基, 所述取代基选自卤素, CN, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₂-C₄-烯基, C₂-C₄-卤代烯基, C₂-C₄-炔基, C₂-C₄-卤代炔基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基, C₁-C₄-烷氧基, C₁-C₄-卤代烷氧基, C₁-C₄-烷硫基和C₁-C₄-卤代烷硫基。

[0304] 更优选, R^{10a}和R^{10b}相互独立地选自氢, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基, 和3-或4-元饱和杂环, 包含1个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的杂原子或杂原子基团作为环成员, 其中所述杂环任选用一个或多个, 优选1、2或3个, 尤其是1个取代基取代, 所述取代基选自卤素, CN, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷氧基; 和特别是相互独立地选自氢, C₁-C₄-烷基和C₁-C₄-卤代烷基。

[0305] 各R¹¹和各R¹⁶各具体值独立地且相互独立地优选选自卤素, CN, 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-烷基磺酰基和C₁-C₄-卤代烷基磺酰基, 和更优选卤素, CN, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷氧基。

[0306] 各R¹²优选选自C₁-C₄-烷基和尤其是甲基。

[0307] 在R¹³是烷基、烯基或炔基上的取代基的情况下, 其优选选自氰基, C₃-C₈-环烷基, C₃-C₈-卤代环烷基, -OH, -SH, 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-卤代烷基磺酰基和苯基, 其可以被1、2或3个残基取代, 所述残基选自卤素, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷氧基。

[0308] 在R¹³是环烷基上的取代基的情况下, 其优选选自氰基, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₃-C₈-环烷基, C₃-C₈-卤代环烷基, -OH, -SH, 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-卤代烷基磺酰基和苯基, 其可以被1、2或3个残基取代, 所述残基选自卤素, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷氧基。

[0309] 在R¹³是环烷基上的取代基的情况下, 其甚至更优选选自卤素, C₁-C₄-烷基, C₁-C₃-卤代烷基, C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₃-卤代烷氧基。尤其是, R¹³作为环烷基上的取代基选自卤素, C₁-C₄-烷基和C₁-C₃-卤代烷基。

[0310] 在R¹³于基团-C(=O)R¹³、-C(=S)R¹³、=C(R¹³)₂或-C(=NR¹⁴)R¹³中的情况下, R⁸优选选自氢, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₃-C₈-环烷基, C₃-C₈-卤代环烷基, -OH, -SH, C₁-C₆-烷氧基, C₁-C₆-卤代烷氧基和苯基, 其可以被1、2或3个残基取代, 所述残基选自卤素, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷氧基。

[0311] R¹⁴、R^{14a}和R^{14b}相互独立地优选选自氢, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₂-C₄-烯基, C₂-C₄-卤代烯基, C₂-C₄-炔基, C₂-C₄-卤代炔基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基和苄基, 其中苄基中的苯基环是任选被1、2或3个, 尤其是1个取代基取代, 所述取代基选自卤素, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷氧基;

[0312] 或者, R^{14a} 和 R^{14b} 与它们结合至的氮原子一起形成5-或6-元饱和、部分不饱和或芳族的杂环,其额外地可以含有1或2个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的其它杂原子或杂原子基团作为环成员,其中所述杂环可以携带1或2个,尤其是1个取代基,所述取代基选自卤素, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷氧基。

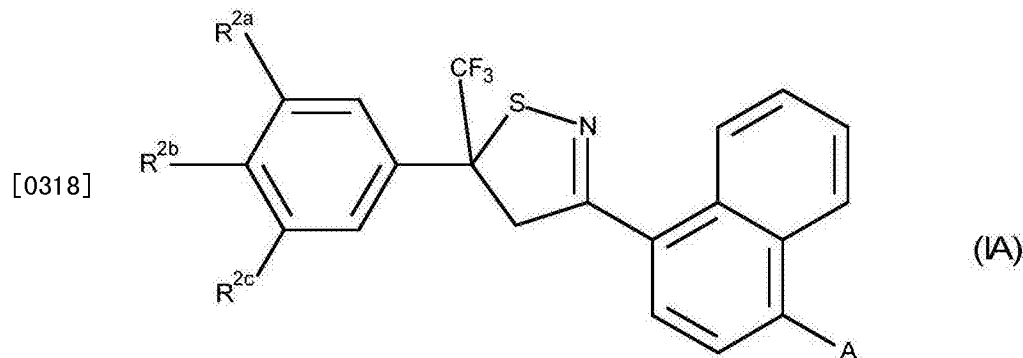
[0313] 更优选, R^{14} , R^{14a} 和 R^{14b} 相互独立地选自氢, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₃-C₆-环烷基, C₃-C₆-卤代环烷基和苄基,其中苄基中的苯基环任选被1、2或3个,尤其是1个取代基取代,所述取代基选自卤素, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷氧基;

[0314] 或者, R^{14a} 和 R^{14b} 与它们结合至的氮原子一起形成5-或6-元饱和、部分不饱和或芳族的杂环,其额外地可以含有1或2个选自N、O、S、NO、SO和SO₂的其它杂原子或杂原子基团作为环成员,其中所述杂环可以携带1或2个,尤其是1个取代基,所述取代基选自卤素, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷氧基。

[0315] 各 R^{15} 优选选自氢, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, 苯基, 苄基, 吡啶基和苯氧基,其中所提及的后4种残基可以是未经取代的和/或携带1、2或3个取代基,所述取代基选自C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₁-C₆-烷氧基和C₁-C₆-卤代烷氧基。

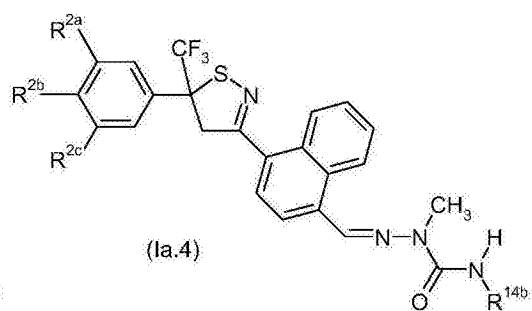
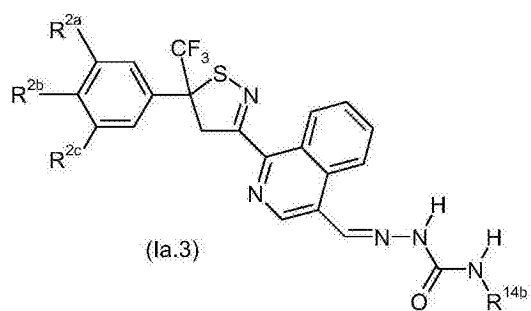
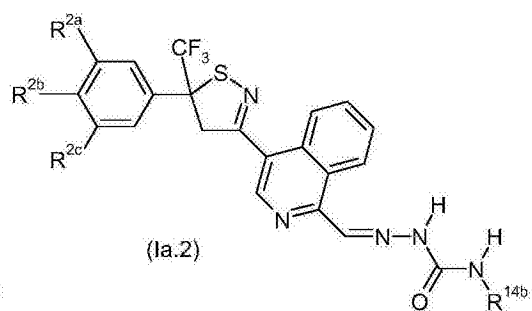
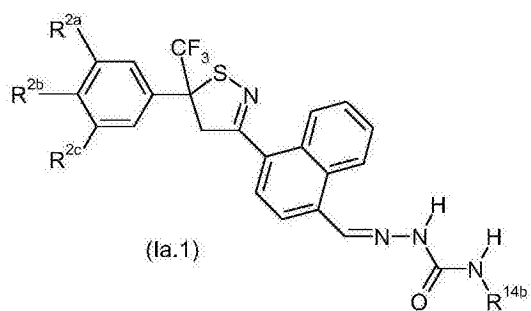
[0316] R^{17} , R^{18a} 和 R^{18b} 相互独立且各次出现独立地优选选自氢, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-卤代烷基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-卤代烯基, C₂-C₆-炔基, C₂-C₆-卤代炔基, C₁-C₆-烷基, 其携带1个取代基,所述取代基选自氰基, C₃-C₄-环烷基, 其可以被1个氰基取代;和C₃-C₄-卤代环烷基; C₃-C₈-环烷基, 其可以携带1个氰基;和C₃-C₈-卤代环烷基。

[0317] 在本发明的特别实施方式中, 化合物I是式IA化合物

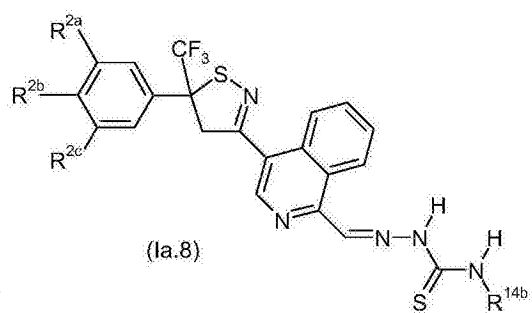
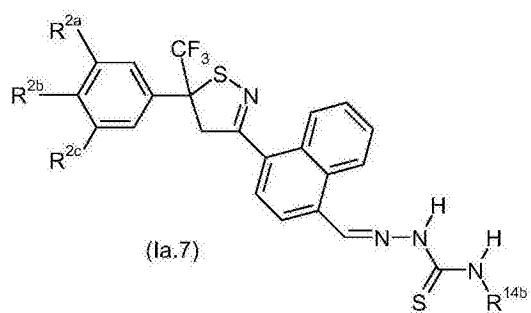
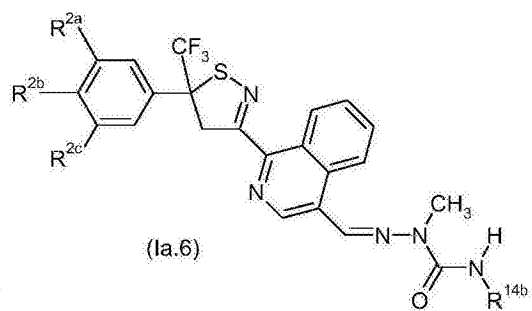
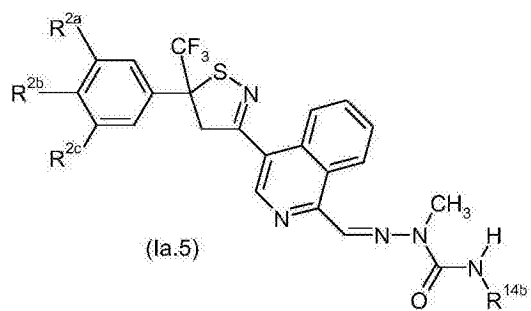


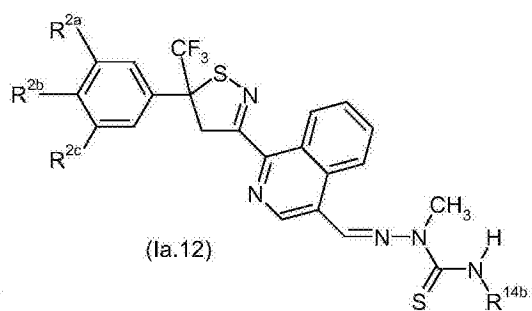
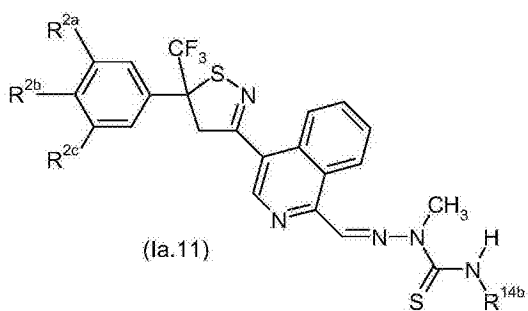
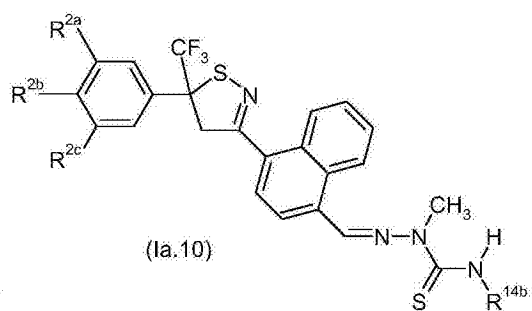
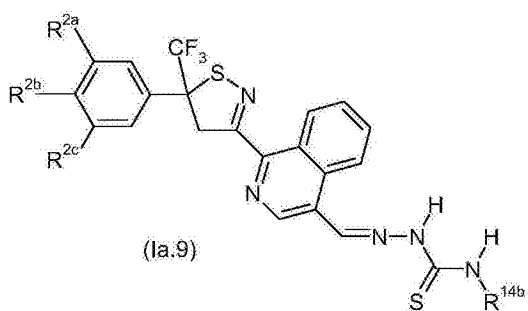
[0319] 其中A具有上述一般含义之一,或尤其是上述优选含义之一,和 R^{2a} , R^{2b} 和 R^{2c} 相互独立地具有 R^2 的上述一般含义之一,或尤其是上述优选含义之一。

[0320] 优选化合物的实例是下式Ia.1至Ia.63的化合物,其中各变量具有上述一般含义或优选含义之一。优选化合物的实例是下表1至24232中列出的单独化合物。此外,下文为表中单独变量提及的含义本身,独立于提及它们的组合地,是有关取代基的特别优选实施方式。

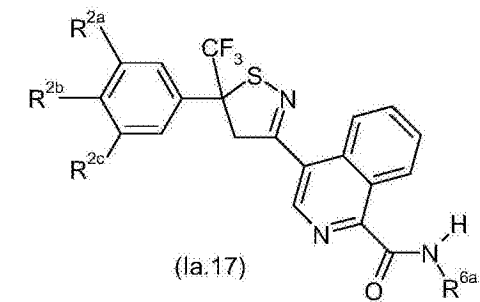
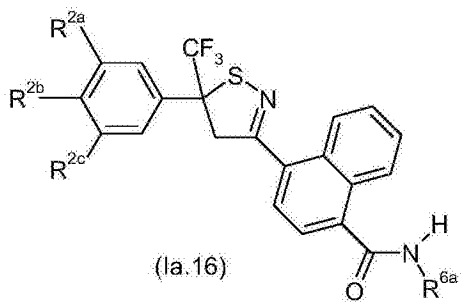
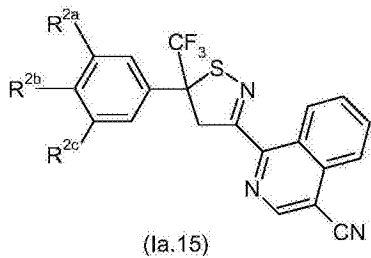
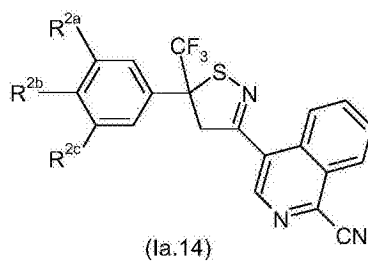
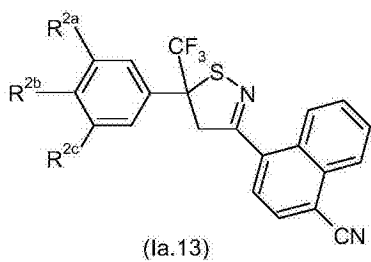


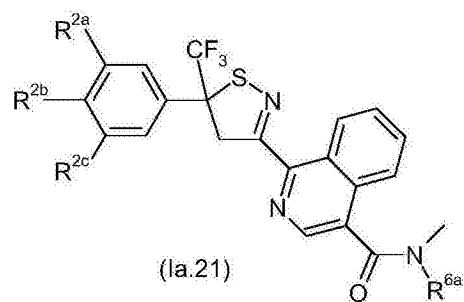
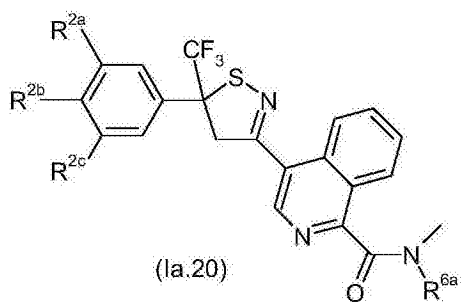
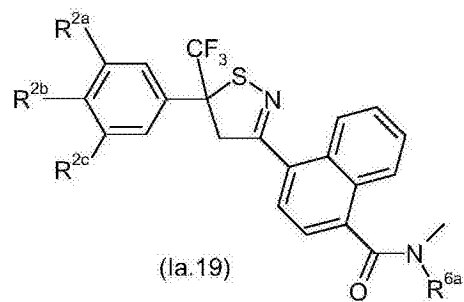
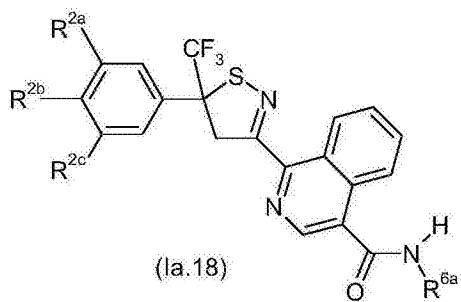
[0321]



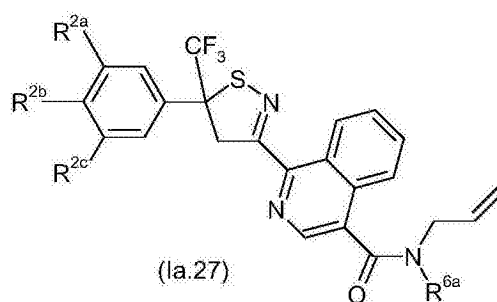
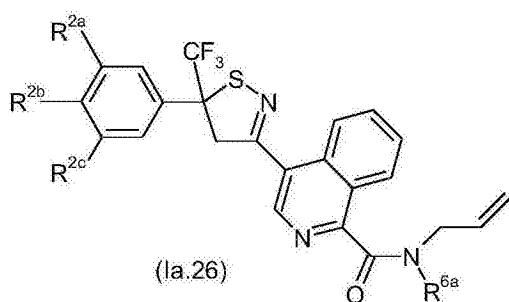
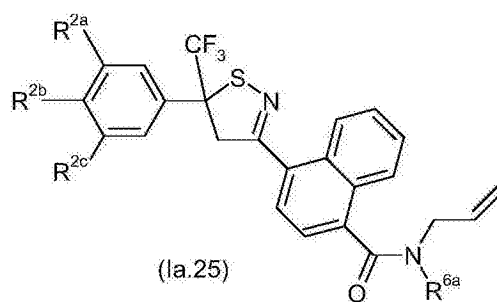
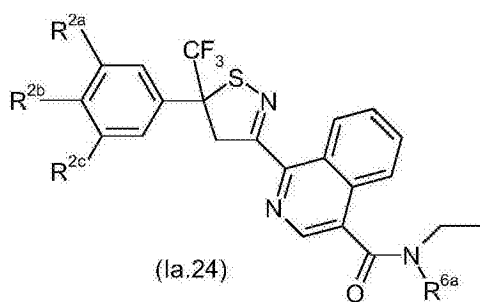
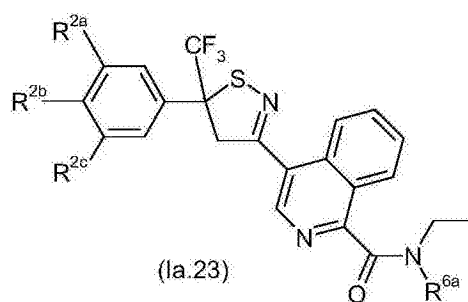
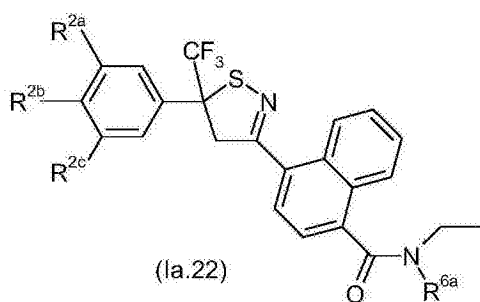


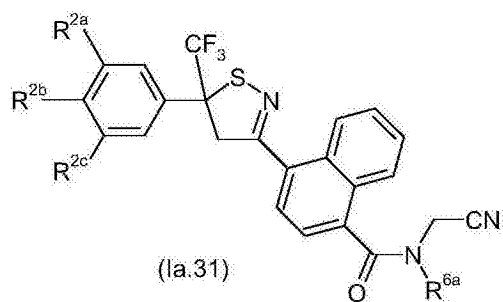
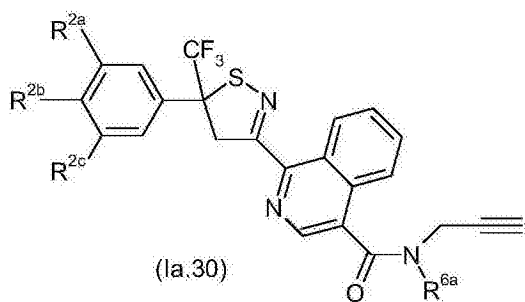
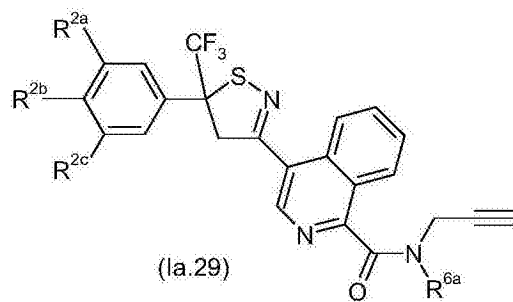
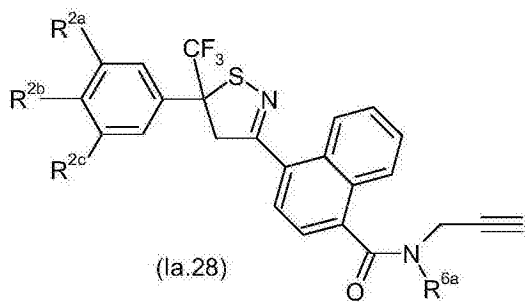
[0322]



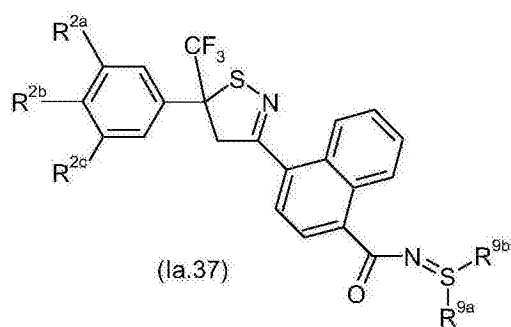
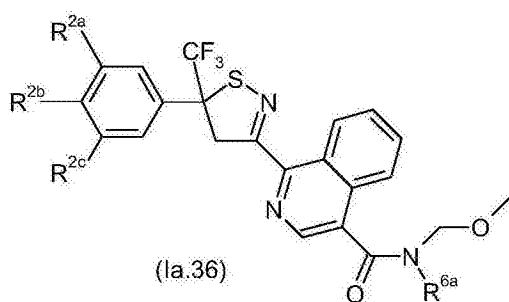
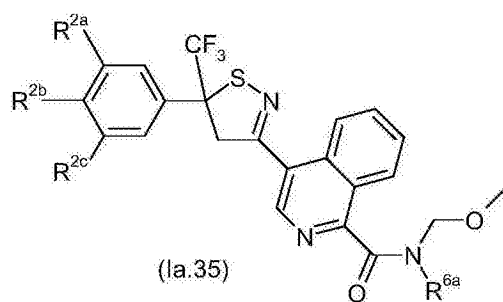
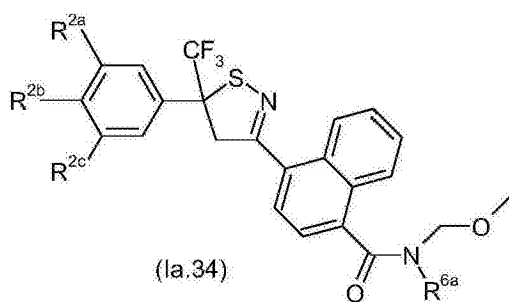
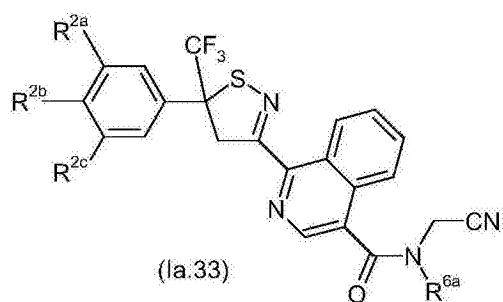
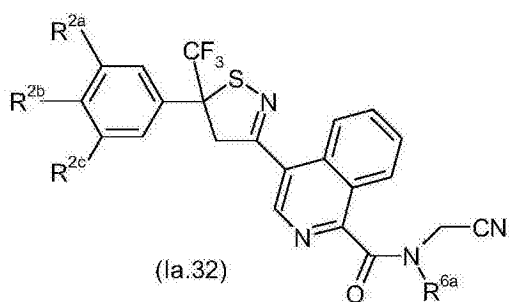


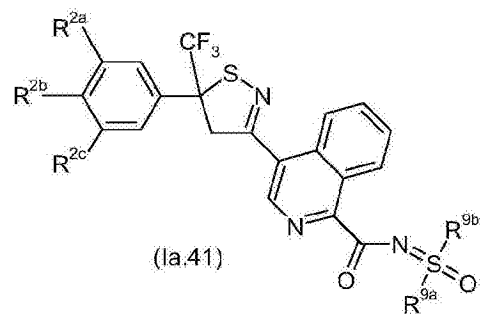
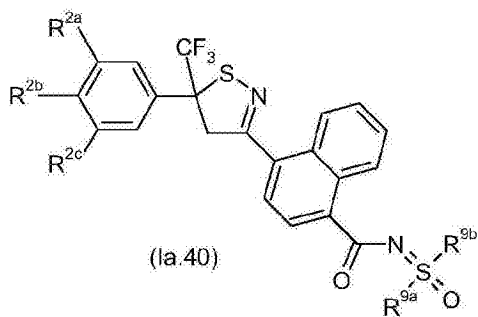
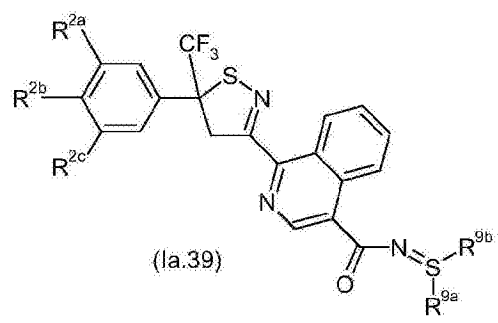
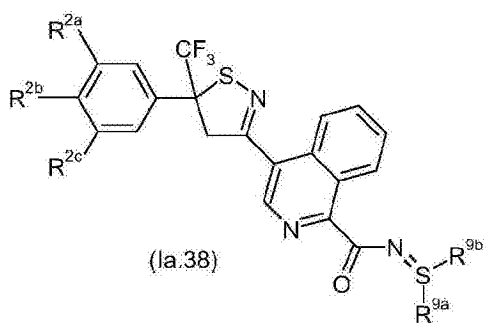
[0323]



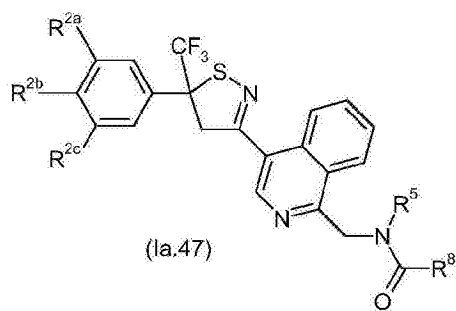
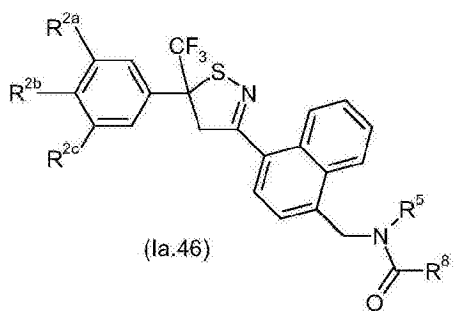
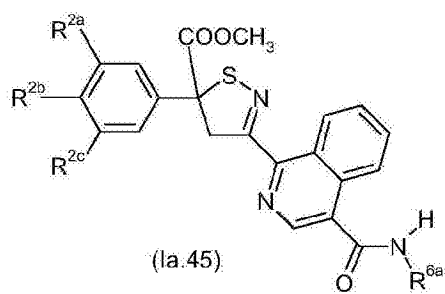
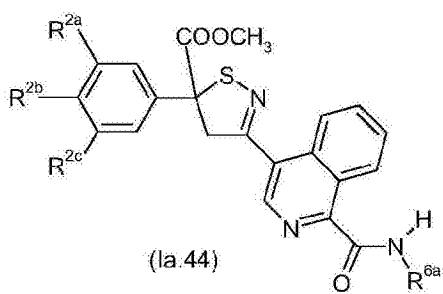
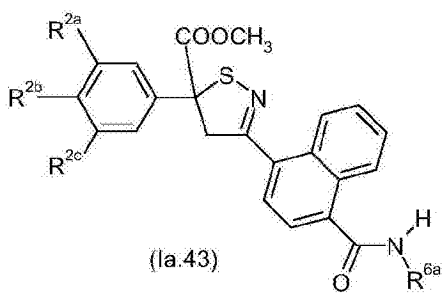
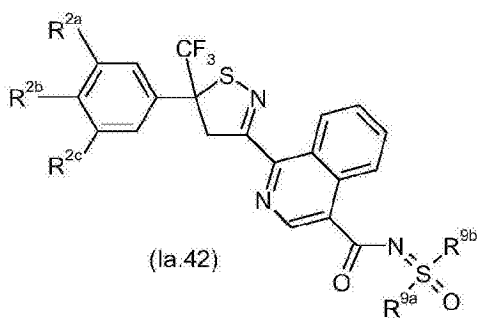


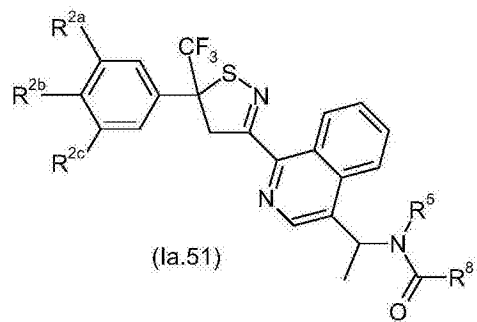
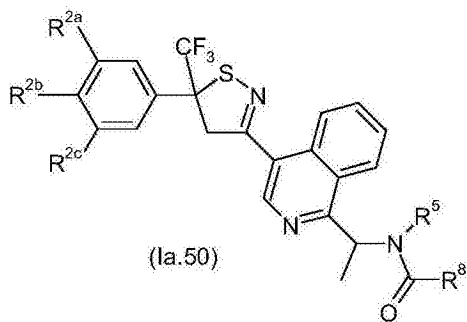
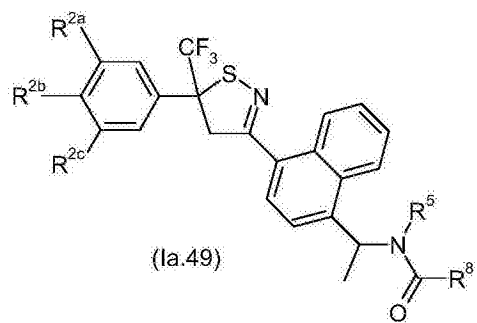
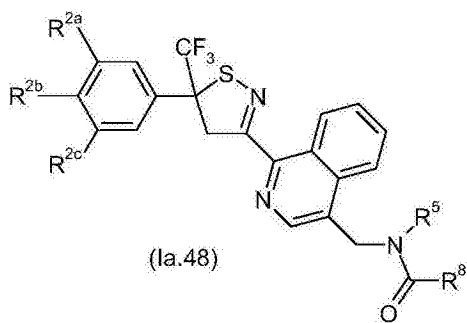
[0324]



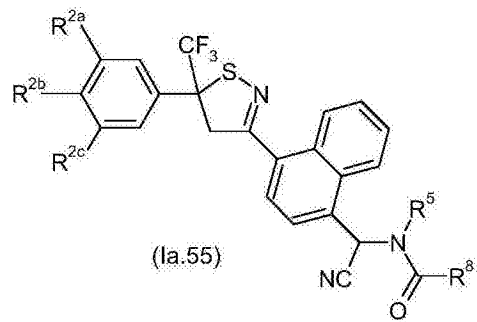
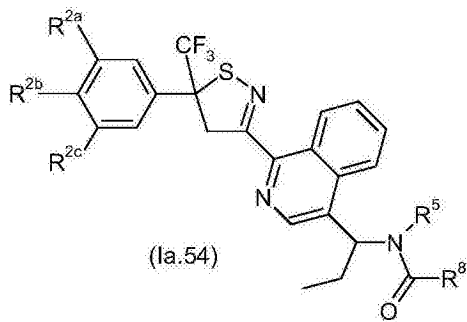
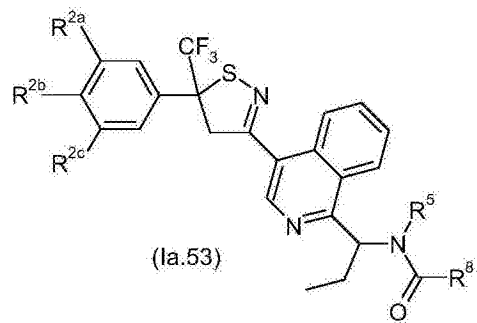
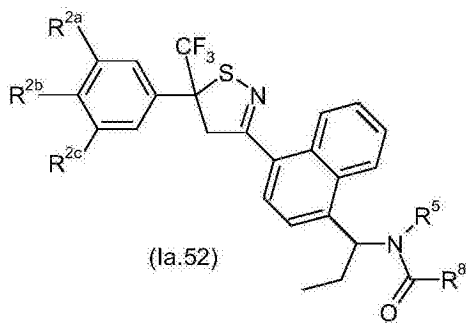


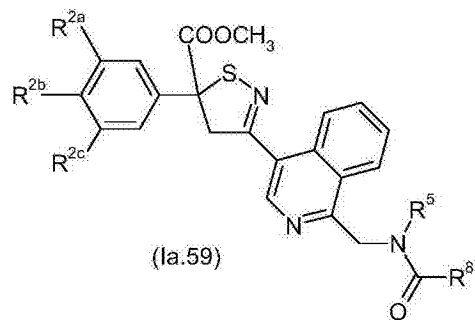
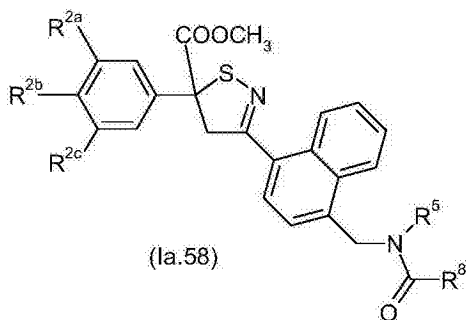
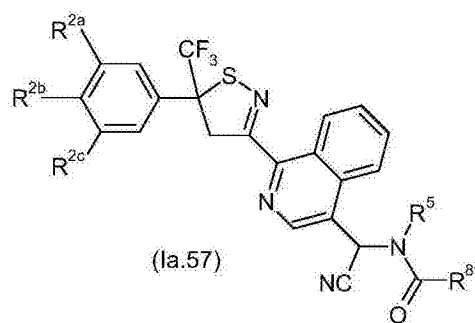
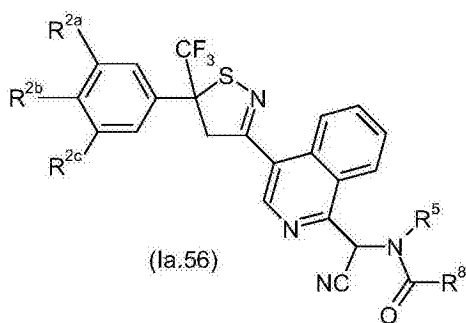
[0325]



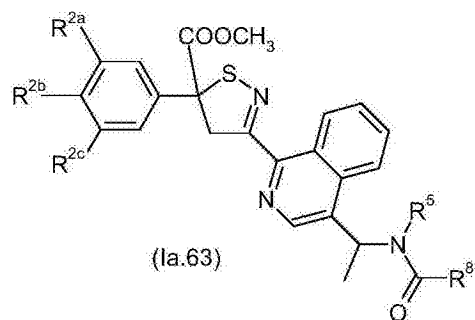
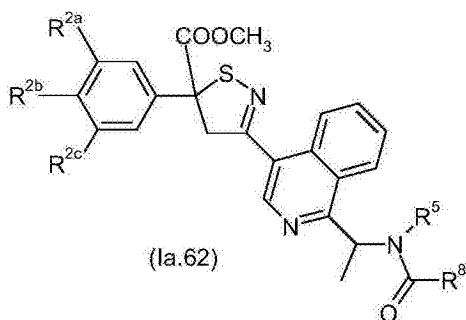
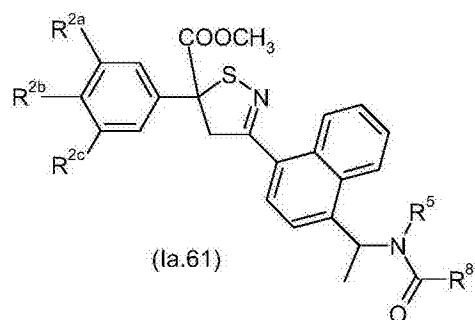
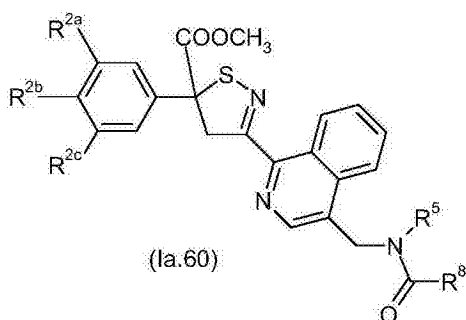


[0326]





[0327]



[0328] 表1式Ia.1化合物,其中R^{14b}是氢,和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0329] 表2式Ia.1化合物,其中R^{14b}是甲基,和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0330] 表3式Ia.1化合物,其中R^{14b}是乙基,和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0331] 表4式Ia.1化合物,其中R^{14b}是丙基,和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况

中对应表A的一行。

[0332] 表5式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是异丙基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0333] 表6式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是正丁基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0334] 表7式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是仲丁基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0335] 表8式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是异丁基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0336] 表9式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是叔丁基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0337] 表10式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是2,2-二氟乙基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0338] 表11式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是2,2,2-三氟乙基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0339] 表12式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是3,3,3-三氟丙基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0340] 表13式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是烯丙基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0341] 表14式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是炔丙基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0342] 表15式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是环丙基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0343] 表16式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是1-氰基环丙基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0344] 表17式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是环丁基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0345] 表18式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是1-氰基环丁基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0346] 表19式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是环戊基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0347] 表20式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是1-氰基环戊基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0348] 表21式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是 CH_2-CN ,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0349] 表22式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是 CH_2 -环丙基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0350] 表23式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是 CH_2 -(1-氰基环丙基),和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0351] 表24式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是 CH_2 -环丁基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0352] 表25式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是 CH_2 -(1-氰基环丁基),和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0353] 表26式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是 CH_2 -环戊基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0354] 表27式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是 CH_2 -(1-氰基环戊基),和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0355] 表28式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是甲氧基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0356] 表29式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是乙氧基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0357] 表30式Ia.1化合物,其中 R^{14b} 是异丙氧基,和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0358] 表31至60

[0359] 式Ia.2化合物,其中 R^{14b} 如表1至30中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0360] 表61至90

[0361] 式Ia.3化合物,其中 R^{14b} 如表1至30中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0362] 表91至120

[0363] 式Ia.4化合物,其中 R^{14b} 如表1至30中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0364] 表121至150

[0365] 式Ia.5化合物,其中 R^{14b} 如表1至30中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0366] 表151至180

[0367] 式Ia.6化合物,其中 R^{14b} 如表1至30中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0368] 表181至210

[0369] 式Ia.7化合物,其中 R^{14b} 如表1至30中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0370] 表211至240

[0371] 式Ia.8化合物,其中 R^{14b} 如表1至30中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0372] 表241至270

[0373] 式Ia.9化合物,其中 R^{14b} 如表1至30中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0374] 表271至300

[0375] 式Ia.10化合物,其中 R^{14b} 如表1至30中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0376] 表301至330

[0377] 式Ia.11化合物,其中 R^{14b} 如表1至30中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0378] 表331至360

[0379] 式Ia.12化合物,其中 R^{14b} 如表1至30中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0380] 表361

[0381] 式Ia.13化合物,其中对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0382] 表362

[0383] 式Ia.14化合物,其中对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0384] 表363

[0385] 式Ia.15化合物,其中对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0386] 表364

[0387] 式Ia.16化合物,其中 R^{6a} 是氢和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0388] 表365

[0389] 式Ia.16化合物,其中 R^{6a} 是1-氰基环丙基和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0390] 表366

[0391] 式Ia.16化合物,其中 R^{6a} 是1-氰基环丁基和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0392] 表367

[0393] 式Ia.16化合物,其中 R^{6a} 是1-氰基环戊基和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0394] 表368

[0395] 式Ia.16化合物,其中 R^{6a} 是 $-\text{CH}_2-$ 环丙基和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0396] 表369

[0397] 式Ia.16化合物,其中 R^{6a} 是 $-\text{CH}_2-(1\text{-氟环丙基})$ 和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0398] 表370

[0399] 式Ia.16化合物,其中 R^{6a} 是 $-\text{CH}_2-(1\text{-氯环丙基})$ 和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0400] 表371

[0401] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(1-氰基环丙基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0402] 表372

[0403] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(2,2-二氟环丙基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0404] 表373

[0405] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(2,2-二氯环丙基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0406] 表374

[0407] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(2,2-二溴环丙基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0408] 表375

[0409] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-环丁基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0410] 表376

[0411] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(1-氟环丁基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0412] 表377

[0413] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(1-氯环丁基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0414] 表378

[0415] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(1-氰基环丁基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0416] 表379

[0417] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(2,2-二氟环丁基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0418] 表380

[0419] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(3,3-二氟环丁基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0420] 表381

[0421] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(2,2,3,3-四氟环丁基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0422] 表382

[0423] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(2,2,3,3,4,4-六氟环丁基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0424] 表383

[0425] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-环戊基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0426] 表384

[0427] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(1-氟环戊基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0428] 表385

[0429] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(1-氯环戊基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0430] 表386

[0431] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(1-氰基环戊基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0432] 表387

[0433] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(2,2-二氟环戊基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0434] 表388

[0435] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(3,3-二氟环戊基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0436] 表389

[0437] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-环己基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0438] 表390

[0439] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(1-氟环己基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0440] 表391

[0441] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(1-氯环己基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0442] 表392

[0443] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-(1-氰基环己基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0444] 表393

[0445] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-CH=CH₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0446] 表394

[0447] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-CH=CF₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0448] 表395

[0449] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-CF=CF₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0450] 表396

[0451] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-C≡CH和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0452] 表397

[0453] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-CH₂-CH=CH₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0454] 表398

[0455] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-CH₂-CH=CF₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0456] 表399

[0457] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-CH₂-CF=CF₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0458] 表400

[0459] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-CH₂-C≡CH和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0460] 表401

[0461] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-CH₂-SO₂-CH₂-CH=CH₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0462] 表402

[0463] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-CH₂-SO₂-CH₂-C≡CH和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0464] 表403

[0465] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-CH₂-SO₂-CH₂-环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0466] 表404

[0467] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-CH₂-O-CH₂-CH=CH₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0468] 表405

[0469] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-CH₂-O-CH₂-C≡CH和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0470] 表406

[0471] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-CH₂-O-CH₂-环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0472] 表407

[0473] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-C(O)-NH-CH₂-CH=CH₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0474] 表408

[0475] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-C(O)-NH-CH₂-C≡CH和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0476] 表409

[0477] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-C(O)-NH-CH₂-环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0478] 表410

[0479] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-CH₂-C(O)-NH-CH₂-(1-氰基环丙基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0480] 表411

[0481] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-NH-C(O)-NH₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0482] 表412

[0483] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-NH-C(O)-N(H)-CH₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0484] 表413

[0485] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-NH-C(O)-N(H)-CH₂CH₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0486] 表414

[0487] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-NH-C(O)-N(H)-CH₂CH₂CH₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0488] 表415

[0489] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-NH-C(O)-N(H)-CH(CH₃)₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0490] 表416

[0491] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-NH-C(O)-N(H)-CH₂CHF₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0492] 表417

[0493] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-NH-C(O)-N(H)-CH₂CF₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0494] 表418

[0495] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-NH-C(O)-N(H)-CH(CH₃)CF₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0496] 表419

[0497] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-NH-C(O)-N(H)-CH(CF₃)₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0498] 表420

[0499] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-NH-C(O)-N(H)-CH₂CN和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0500] 表421

[0501] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-NH-C(O)-N(H)-CH₂CH=CH₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0502] 表422

[0503] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-NH-C(O)-N(H)-CH₂C≡CH和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0504] 表423

[0505] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-NH-C(O)-N(H)-环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0506] 表424

[0507] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-NH-C(O)-N(H)-(1-氰基环丙基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0508] 表425

[0509] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-NH-C(O)-N(H)-环丁基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0510] 表426

[0511] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-NH-C(O)-N(H)-(1-氰基环丁基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0512] 表427

[0513] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-NH-C(O)-N(H)-CH₂-环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0514] 表428

[0515] 式Ia.16化合物,其中R^{6a}是-NH-C(O)-N(H)-CH₂-(1-氰基环丙基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0516] 表429至493

[0517] 式Ia.17化合物,其中R^{6a}如表364至428中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0518] 表494至558

[0519] 式Ia.18化合物,其中R^{6a}如表364至428中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0520] 表559至619

[0521] 式Ia.19化合物,其中R^{6a}如表368至428中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0522] 表620至680

[0523] 式Ia.20化合物,其中R^{6a}如表368至428中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0524] 表681至741

[0525] 式Ia.21化合物,其中R^{6a}如表368至428中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0526] 表742至802

[0527] 式Ia.22化合物,其中R^{6a}如表368至428中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0528] 表803至863

[0529] 式Ia.23化合物,其中R^{6a}如表368至428中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0530] 表864至924

[0531] 式Ia.24化合物,其中 R^{6a} 如表368至428中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0532] 表925至985

[0533] 式Ia.25化合物,其中 R^{6a} 如表368至428中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0534] 表986至1046

[0535] 式Ia.26化合物,其中 R^{6a} 如表368至428中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0536] 表1047至1107

[0537] 式Ia.27化合物,其中 R^{6a} 如表368至428中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0538] 表1108至1168

[0539] 式Ia.28化合物,其中 R^{6a} 如表368至428中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0540] 表1169至1229

[0541] 式Ia.29化合物,其中 R^{6a} 如表368至428中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0542] 表1230至1290

[0543] 式Ia.30化合物,其中 R^{6a} 如表368至428中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0544] 表1291至1351

[0545] 式Ia.31化合物,其中 R^{6a} 如表368至428中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0546] 表1352至1412

[0547] 式Ia.32化合物,其中 R^{6a} 如表368至428中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0548] 表1413至1473

[0549] 式Ia.33化合物,其中 R^{6a} 如表368至428中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0550] 表1474至1534

[0551] 式Ia.34化合物,其中 R^{6a} 如表368至428中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0552] 表1535至1595

[0553] 式Ia.35化合物,其中 R^{6a} 如表368至428中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0554] 表1596至1656

[0555] 式Ia.36化合物,其中 R^{6a} 如表368至428中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0556] 表1657

[0557] 式Ia.37化合物,其中 R^{9a} 和 R^{9a} 是甲基和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0558] 表1658

[0559] 式Ia.37化合物,其中 R^{9a} 和 R^{9a} 是乙基和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0560] 表1659

[0561] 式Ia.37化合物,其中 R^{9a} 和 R^{9a} 是丙基和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0562] 表1660

[0563] 式Ia.37化合物,其中 R^{9a} 和 R^{9a} 是异丙基和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0564] 表1661至1664

[0565] 式Ia.38化合物,其中 R^{9a} 和 R^{9a} 如表1657至1660中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0566] 表1665至1668

[0567] 式Ia.39化合物,其中 R^{9a} 和 R^{9a} 如表1657至1660中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0568] 表1669至1672

[0569] 式Ia.40化合物,其中 R^{9a} 和 R^{9a} 如表1657至1660中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0570] 表1673至1676

[0571] 式Ia.41化合物,其中 R^{9a} 和 R^{9a} 如表1657至1660中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0572] 表1677至1680

[0573] 式Ia.42化合物,其中 R^{9a} 和 R^{9a} 如表1657至1660中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0574] 表1681至1745

[0575] 式Ia.43化合物,其中 R^{6a} 如表364至428中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0576] 表1746至1810

[0577] 式Ia.44化合物,其中 R^{6a} 如表364至428中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0578] 表1811至1875

[0579] 式Ia.45化合物,其中 R^{6a} 如表364至428中任意表所定义和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0580] 表1876

[0581] 式Ia.46化合物,其中 R^5 是氢, R^8 是氢和对于化合物的 R^{2a} 、 R^{2b} 和 R^{2c} 的组合在各情况中对应表A的一行。

[0582] 表1877

[0583] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是甲基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0584] 表1878

[0585] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是乙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0586] 表1879

[0587] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0588] 表1880

[0589] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是异丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0590] 表1881

[0591] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是正丁基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0592] 表1882

[0593] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是仲丁基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0594] 表1883

[0595] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是异丁基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0596] 表1884

[0597] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是叔丁基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0598] 表1885

[0599] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是CH₂F和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0600] 表1886

[0601] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是CHF₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0602] 表1887

[0603] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是CF₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0604] 表1888

[0605] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是CH₂CHF₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0606] 表1889

[0607] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是CH₂CF₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0608] 表1890

[0609] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是CF₂CF₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0610] 表1891

[0611] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是CH₂CH₂CF₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0612] 表1892

[0613] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是CH(CH₃)CF₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0614] 表1893

[0615] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是CH(CF₃)₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0616] 表1894

[0617] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是CF(CF₃)₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0618] 表1895

[0619] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是CH₂CN和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0620] 表1896

[0621] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH=CH₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0622] 表1897

[0623] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是烯丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0624] 表1898

[0625] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-C≡CH和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0626] 表1899

[0627] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是炔丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0628] 表1900

[0629] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是CN和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0630] 表1901

[0631] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH=CHF和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0632] 表1902

[0633] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH=CF₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0634] 表1903

[0635] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CF=CF₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0636] 表1904

[0637] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0638] 表1905

[0639] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是1-氟环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0640] 表1906

[0641] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是1-氰基环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0642] 表1907

[0643] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是环丁基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0644] 表1908

[0645] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是1-氟环丁基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0646] 表1909

[0647] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是1-氰基环丁基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0648] 表1910

[0649] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是环丁-1-烯基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0650] 表1911

[0651] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH₂-环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0652] 表1912

[0653] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH₂-(1-氰基环丙基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0654] 表1913

[0655] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH₂-环丁基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0656] 表1914

[0657] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH₂-(1-氰基环丁基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0658] 表1915

[0659] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是氧杂环丁烷-2-基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0660] 表1916

[0661] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是氧杂环丁烷-3-基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0662] 表1917

[0663] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是四氢呋喃-2-基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0664] 表1918

[0665] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是四氢呋喃-3-基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0666] 表1919

[0667] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是硫杂环丁烷-3-基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0668] 表1920

[0669] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是1-氧代-硫杂环丁烷-3-基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0670] 表1921

[0671] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是1,1-二氧化-硫杂环丁烷-3-基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0672] 表1922

[0673] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是苯基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0674] 表1923

[0675] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是2-氟苯基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0676] 表1924

[0677] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是3-氟苯基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0678] 表1925

[0679] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是4-氟苯基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0680] 表1926

[0681] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是2,3-二氟苯基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0682] 表1927

[0683] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是2,4-二氟苯基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0684] 表1928

[0685] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是2,5-二氟苯基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0686] 表1929

[0687] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是2,6-二氟苯基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0688] 表1930

[0689] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是3,4-二氟苯基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0690] 表1931

[0691] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是3,5-二氟苯基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0692] 表1932

[0693] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是2-氯苯基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0694] 表1933

[0695] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是3-氯苯基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0696] 表1934

[0697] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是4-氯苯基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0698] 表1935

[0699] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是2-甲氧基苯基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0700] 表1936

[0701] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是3-甲氧基苯基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0702] 表1937

[0703] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是4-甲氧基苯基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0704] 表1938

[0705] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是吡啶-2-基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0706] 表1939

[0707] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是吡啶-3-基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0708] 表1940

[0709] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是吡啶-4-基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0710] 表1941

[0711] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是4-氯吡啶-3-基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0712] 表1942

[0713] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是嘧啶-2-基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0714] 表1943

[0715] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是甲氧基甲基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0716] 表1944

[0717] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是乙氧基甲基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0718] 表1945

[0719] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是三氟甲氧基甲基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0720] 表1946

[0721] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是甲硫基甲基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0722] 表1947

[0723] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是乙硫基甲基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0724] 表1948

[0725] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是三氟甲硫基甲基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0726] 表1949

[0727] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是甲基亚磺酰基甲基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0728] 表1950

[0729] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是乙基亚磺酰基甲基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0730] 表1951

[0731] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是三氟甲基亚磺酰基甲基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0732] 表1952

[0733] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是甲磺酰基甲基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0734] 表1953

[0735] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是乙基磺酰基甲基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0736] 表1954

[0737] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是三氟甲基磺酰基甲基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0738] 表1955

[0739] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH(CH₃)-SO₂-CH₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0740] 表1956

[0741] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-C(CH₃)₂-SO₂-CH₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0742] 表1957

[0743] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH₂-N(CH₃)₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0744] 表1958

[0745] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH₂-CH₂-N(CH₃)₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0746] 表1959

[0747] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-N(H)CH₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0748] 表1960

[0749] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-N(H)CH₂CH₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0750] 表1961

[0751] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-N(H)CH₂CHF₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0752] 表1962

[0753] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-N(H)CH₂CF₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0754] 表1963

[0755] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-N(H)CH₂CH=CH₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0756] 表1964

[0757] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-N(H)CH₂C≡CH和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0758] 表1965

[0759] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-N(H)CH₂CN和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0760] 表1966

[0761] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-N(H)-环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0762] 表1967

[0763] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-N(H)-(1-氰基环丙基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0764] 表1968

[0765] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-N(H)-CH₂-环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0766] 表1969

[0767] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-N(H)-CH₂-(1-氰基环丙基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0768] 表1970

[0769] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-C(O)-N(H)CH₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0770] 表1971

[0771] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-C(O)-N(H)CH₂CH₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0772] 表1972

[0773] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-C(O)-N(H)CH₂CHF₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0774] 表1973

[0775] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-C(O)-N(H)CH₂CF₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0776] 表1974

[0777] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-C(O)-N(H)CH₂CH=CH₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0778] 表1975

[0779] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-C(O)-N(H)CH₂C≡CH和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0780] 表1976

[0781] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-C(O)-N(H)CH₂CN和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0782] 表1977

[0783] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-C(O)-N(H)-环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0784] 表1978

[0785] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-C(O)-N(H)-(1-氰基环丙基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0786] 表1979

[0787] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-C(O)-N(H)-CH₂-环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0788] 表1980

[0789] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-C(O)-N(H)-CH₂-(1-氰基环丙基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0790] 表1981

[0791] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH₂-C(O)-N(H)CH₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0792] 表1982

[0793] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH₂-C(O)-N(H)CH₂CH₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0794] 表1983

[0795] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH₂-C(O)-N(H)CH₂CHF₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0796] 表1984

[0797] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH₂-C(O)-N(H)CH₂CF₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0798] 表1985

[0799] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH₂-C(O)-N(H)CH₂CH=CH₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0800] 表1986

[0801] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH₂-C(O)-N(H)CH₂C≡CH和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0802] 表1987

[0803] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH₂-C(O)-N(H)CH₂CN和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0804] 表1988

[0805] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH₂-C(O)-N(H)-环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0806] 表1989

[0807] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH₂-C(O)-N(H)-(1-氰基环丙基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0808] 表1990

[0809] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH₂-C(O)-N(H)-CH₂-环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0810] 表1991

[0811] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH₂-C(O)-N(H)-CH₂-(1-氰基环丙基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0812] 表1992

[0813] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-NH-C(O)-N(H)CH₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0814] 表1993

[0815] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-NH-C(O)-N(H)CH₂CH₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0816] 表1994

[0817] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-NH-C(O)-N(H)CH₂CHF₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0818] 表1995

[0819] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-NH-C(O)-N(H)CH₂CF₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0820] 表1996

[0821] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-NH-C(O)-N(H)CH₂CH=CH₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0822] 表1997

[0823] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-NH-C(O)-N(H)CH₂C≡CH和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0824] 表1998

[0825] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-NH-C(O)-N(H)CH₂CN和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0826] 表1999

[0827] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-NH-C(O)-N(H)-环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0828] 表2000

[0829] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-NH-C(O)-N(H)-(1-氰基环丙基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0830] 表2001

[0831] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-NH-C(O)-N(H)-CH₂-环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0832] 表2002

[0833] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-NH-C(O)-N(H)-CH₂-(1-氰基环丙基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0834] 表2003

[0835] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH=N-OCH₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0836] 表2004

[0837] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH=N-OCH₂CH₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0838] 表2005

[0839] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH=N-OCH₂CHF₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0840] 表2006

[0841] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH=N-OCH₂CF₃和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0842] 表2007

[0843] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH=N-OCH₂CH=CH₂和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0844] 表2008

[0845] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH=N-OCH₂C≡CH和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0846] 表2009

[0847] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH=N-OCH₂CN和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0848] 表2010

[0849] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH=N-O-环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0850] 表2011

[0851] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH=N-O-(1-氰基环丙基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0852] 表2012

[0853] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH=N-O-CH₂-环丙基和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0854] 表2013

[0855] 式Ia.46化合物,其中R⁵是氢,R⁸是-CH=N-O-CH₂-(1-氰基环丙基)和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0856] 表2014至2151

[0857] 式Ia.46化合物,其中R⁵是甲基,R⁸如表1876至2013中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0858] 表2152至2289

[0859] 式Ia.46化合物,其中R⁵是乙基,R⁸如表1876至2013中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0860] 表2290至2427

[0861] 式Ia.46化合物,其中R⁵是烯丙基,R⁸如表1876至2013中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0862] 表2428至2565

[0863] 式Ia.46化合物,其中R⁵是炔丙基,R⁸如表1876至2013中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0864] 表2566至2703

[0865] 式Ia.46化合物,其中R⁵是CH₂CHF₂,R⁸如表1876至2013中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0866] 表2704至2841

[0867] 式Ia.46化合物,其中R⁵是CH₂CF₃,R⁸如表1876至2013中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0868] 表2842至2979

[0869] 式Ia.46化合物,其中R⁵是CH₂CN,R⁸如表1876至2013中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0870] 表2980至3117

[0871] 式Ia.46化合物,其中R⁵是CH₂OCH₃,R⁸如表1876至2013中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0872] 表3118至4360

[0873] 式Ia.47化合物,其中R⁵和R⁸合并的含义如表1876至3117中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0874] 表4361至5602

[0875] 式Ia.48化合物,其中R⁵和R⁸合并的含义如表1876至3117中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0876] 表5603至6844

[0877] 式Ia.49化合物,其中R⁵和R⁸合并的含义如表1876至3117中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0878] 表6845至8086

[0879] 式Ia.50化合物,其中R⁵和R⁸合并的含义如表1876至3117中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0880] 表8087至9328

[0881] 式Ia.51化合物,其中R⁵和R⁸合并的含义如表1876至3117中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0882] 表9329至10570

[0883] 式Ia.52化合物,其中R⁵和R⁸合并的含义如表1876至3117中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0884] 表10571至11812

[0885] 式Ia.53化合物,其中R⁵和R⁸合并的含义如表1876至3117中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0886] 表11813至13054

[0887] 式Ia.54化合物,其中R⁵和R⁸合并的含义如表1876至3117中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0888] 表13055至14296

[0889] 式Ia.55化合物,其中R⁵和R⁸合并的含义如表1876至3117中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0890] 表14297至15538

[0891] 式Ia.56化合物,其中R⁵和R⁸合并的含义如表1876至3117中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0892] 表15539至16780

[0893] 式Ia.57化合物,其中R⁵和R⁸合并的含义如表1876至3117中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0894] 表16781至18022

[0895] 式Ia.58化合物,其中R⁵和R⁸合并的含义如表1876至3117中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0896] 表18023至19264

[0897] 式Ia.59化合物,其中R⁵和R⁸合并的含义如表1876至3117中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0898] 表19265至20506

[0899] 式Ia.60化合物,其中R⁵和R⁸合并的含义如表1876至3117中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0900] 表20507至21748

[0901] 式Ia.61化合物,其中R⁵和R⁸合并的含义如表1876至3117中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0902] 表21749至22990

[0903] 式Ia.62化合物,其中R⁵和R⁸合并的含义如表1876至3117中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0904] 表22991至24232

[0905] 式Ia.63化合物,其中R⁵和R⁸合并的含义如表1876至3117中任意表所定义和对于化合物的R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}的组合在各情况中对应表A的一行。

[0906] 表A

[0907]

编号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}
A-1	F	H	F
A-2	F	F	F
A-3	F	Cl	F
A-4	F	Br	F
A-5	F	H	Cl
A-6	F	H	Br

[0908]

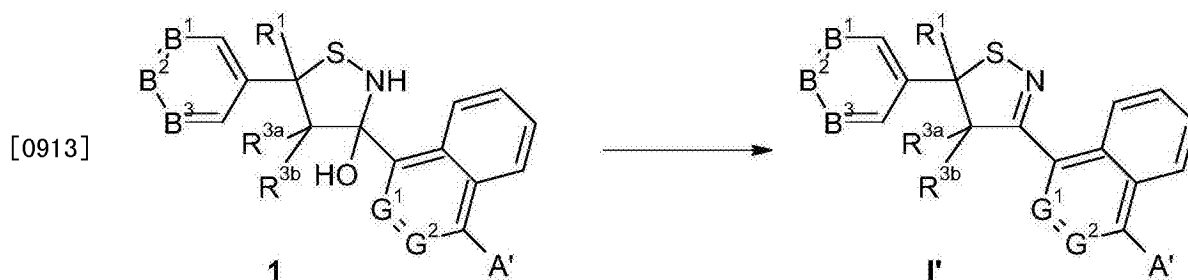
编号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}
A-7	Cl	H	Cl
A-8	Cl	Cl	Cl
A-9	Cl	F	Cl
A-10	Cl	Br	Cl
A-11	Cl	H	Br
A-12	Br	H	Br
A-13	Br	F	Br
A-14	Br	Cl	Br
A-15	CF ₃	H	F
A-16	CF ₃	H	Cl
A-17	CF ₃	H	Br
A-18	CF ₃	H	CF ₃
A-19	CF ₃	F	F
A-20	CF ₃	Cl	Cl
A-21	CF ₃	Br	Br
A-22	SF ₅	H	F
A-23	SF ₅	H	Cl
A-24	SF ₅	H	Br
A-25	SF ₅	H	CF ₃
A-26	SF ₅	H	H
A-27	CF ₃	H	H
A-28	Br	H	H
A-29	Cl	H	H
A-30	F	H	H

[0909] 在上述化合物中,优选化合物Ia.1,Ia.13,Ia.16和Ia.46,其中Ia.16是特别优选的。

[0910] 式(I)化合物能够通过在下述方案或合成说明中或在实施例的合成说明中描述的方法或通过有机化学标准方法来制备。取代基、变量和指数如前文对式(I)所定义,如果并未另外指定。

[0911] 式I化合物能够通过脱水式1化合物制备,如下文方案1中所示。A'是A或A的前体。A的典型前体是卤素原子,CN,羧基,叔丁氧基羰基,乙酸酯基团,保护的醛基团或-OSO₂-R²¹,其中R²¹是C₁-C₄-烷基,C₁-C₄-卤代烷基或苯基,其可以被1、2或3个残基取代,所述残基选自C₁-C₄-烷基,C₁-C₄-卤代烷基C₁-C₄-烷氧基或C₁-C₄-卤代烷氧基。化合物I'相应于A'是A的化合物I。脱水自发或借助脱水剂进行,比如分子筛,酸洗的分子筛,硫酸镁,硫酸钠,硅胶,SOCl₂,POCl₃,Burgess试剂,三氟乙酸酐,对甲苯磺酸,无水的HCl或硫酸。优选,使用对甲苯磺酸或酸洗的分子筛。形成的水可以另选地通过例如共沸蒸馏除去,例如用苯/甲苯作为共沸剂,例如用Dean Stark装置。如果必需(也即如果A'是A的前体),然后将A'转化为基团A。

[0912] 方案1



[0914] 化合物1,其中R^{3b}是氢,能够制备如下:将化合物3与胺化剂反应以提供式2化合物,其自发反应为化合物1,如方案2中所示。取决于所用的胺化剂,胺化能够在1步反应中进行,其中化合物3直接反应为化合物2;或作为2步反应,其中化合物3的SH基团首先氧化为S-Cl基团,其然后进一步反应为S-NH₂基团,从而提供化合物2。

[0915] 用于1步反应的适宜胺化剂是例如HOSA(羟胺-O-磺酸),其一般在碱存在下使用(适宜碱是例如磷酸氢钠,磷酸氢二钾,氢氧化钠,氢氧化钾,碳酸钠,碳酸钾,甲醇钠,三乙胺等),O-(二苯基磷酰基)羟胺,其也一般在碱存在下使用(适宜碱是例如磷酸氢钠,磷酸氢二钾,氢氧化钠,氢氧化钾,碳酸钠,碳酸钾,甲醇钠,三乙胺等),2,4-二硝基苯基羟胺,O-均三甲苯磺酰基羟胺和2-氧杂-1-氮杂螺[2.5]辛烷;在其中HOSA和O-(二苯基磷酰基)羟胺是优选的。胺化一般在溶剂中进行,适宜溶剂是例如氯化烷烃比如二氯甲烷或氯仿,芳族溶剂比如苯,甲苯,各种二甲苯,氯苯或二氯苯,和醚比如二乙醚,二丙基醚,甲基叔丁基醚,甲基异丁基醚,乙二醇二甲基醚,四氢呋喃(THF)或二噁烷等。反应适宜地在低温下进行,例如-100至0℃或-78至0℃。一般地,将化合物3分散于溶剂中和冷却至所希望的温度,加入碱、随后是胺化剂,或加入胺化剂、随后是碱,或同时加入碱和胺化剂。HOSA适宜地与胺碱比如三乙胺组合使用。在该情况中,优选将化合物3冷却至-30至0℃,优选-20至-10℃,在该温度添加胺碱、然后是HOSA,将反应保持在大约-10至0℃。

[0916] 另选地,O-(二苯基磷酰基)羟胺能够与碱组合使用,例如无机碱,比如磷酸氢钠,磷酸氢二钾,氢氧化钠,氢氧化钾,碳酸钠或碳酸钾和特别是磷酸氢钠。在该情况下,适宜的是将化合物3冷却到-80至-30℃,特别是-80至-70℃,在该温度加碱、然后是O-(二苯基磷酰基)羟胺,将反应保持在大约0℃至室温。

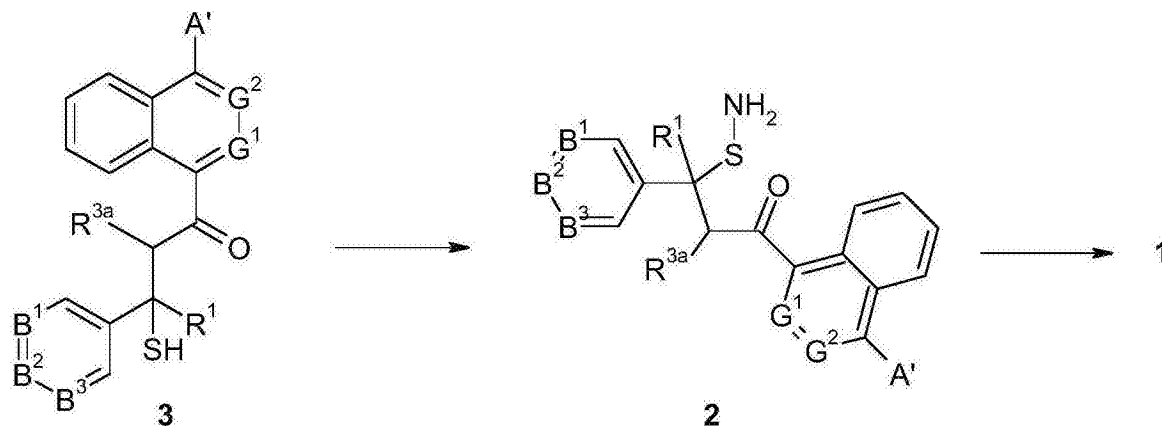
[0917] 在2步反应中,将化合物3首先与氯化剂反应,其将SH基团转化为S-Cl基团。适宜的氯化剂是例如磺酰氯,N-氯琥珀酰亚胺(NCS),次氯酸钠,一氯胺(NH₂Cl)或氯,其优选在FeCl₃存在下使用。氯化能够类似于Synthesis 1987,1987,683-688,Tetrahedron 66(36),2010,7279-7287,J.Org.Chem.59(4),1994,914-921,J.Org.Chem.63,1998,4878-4888或J.Chem Soc.1938,2114-2117所描述的方法地进行。氯化一般在溶剂中进行。适宜溶剂是例如醚,比如二乙醚,二丙基醚,甲基叔丁基醚,甲基异丁基醚,乙二醇二甲基醚,四氢呋喃或二噁烷。反应温度能够在宽范围变化,并一般是0℃至反应混合物沸点(如果使用溶剂)。然后,反应氯化的化合物,而不用氨或氢氧化铵分离。如果使用无水氨,则反应一般在-78至-33℃进行。如果使用含水的氨或氢氧化铵,反应还能够在较高温度比如0至25℃进行。反应一般在溶剂中进行。适宜的溶剂是例如上述的醚,其中优选水可混合的醚,比如THF和二噁烷。通常,将氯化的化合物溶于溶剂,向其加入氨或氢氧化铵。反应能够按例如Synthesis,1987,8,683-688的描述进行。氯化/胺化还能够按一锅反应进行。例如,硫醇3同时与氯化剂(比如NCS或含水次氯酸钠)和无水或含水氨在醚类溶剂(比如THF或Et₂O)或水中反应。优选

的是在 -33°C 、在THF和无水液氨混合物中与NCS反应。例如，在 -78°C 将硫醇3的THF溶液加至NCS(N-氯代琥珀酰亚胺)的THF/液氨溶液。将溶液温热至 -30°C 和搅拌直至氨已蒸发。另选地，在 0°C ，将硫醇钠(NaSR)的水溶液加至含水氨(25%)和含水次氯酸钠(1N)的混合物。一锅氯化/胺化反应能够按例如Tetrahedron 2010, 66, 7279-7287或J.Org.Chem.1994, 59, 914-921中的描述进行。

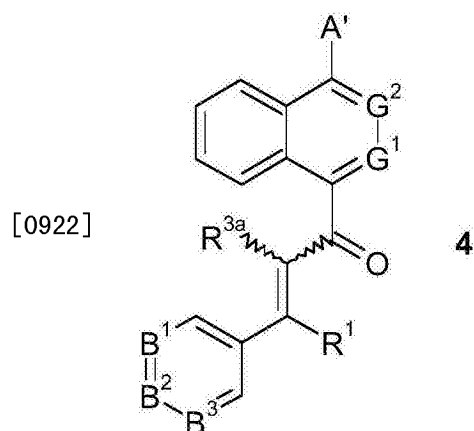
[0918] 化合物2能够实质上不加分离，原因在于其一般自发在关环反应中反应形成化合物1。

[0919] 方案2

[0920]



[0921] 式3化合物能够制备如下：将式4化合物



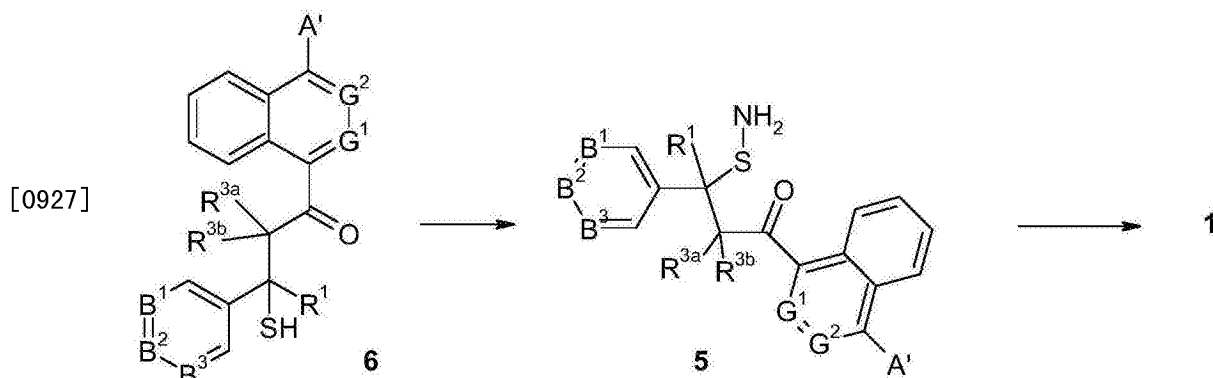
[0923] 与硫源反应。适宜的硫源是例如 H_2S ，金属硫化氢，比如NaSH或KSH，金属硫化物，比如 Na_2S ， K_2S ， Li_2S ， Cu_2S ， MgS ， CaS ， CuS ， FeS 等，硫化铵 $[(\text{NH}_4)_2\text{S}]$ ，四烷基硫化铵 (R_4NSH) ，比如四甲基硫化铵，四乙基硫化铵，四丙基硫化铵等，或二(三甲基)甲硅烷基硫化物。 H_2S 作为硫源一般在碱存在下使用，所述碱是比如 Na_2CO_3 ， K_2CO_3 ， Cs_2CO_3 ，乙酸钠，乙酸钾，乙酸铯，胺比如二乙胺、二丙胺、三乙胺、二异丙基乙胺等，或碱性含氮杂环比如吡咯烷、哌啶、哌嗪、吡啶、卢剔啶等。另选地， H_2S 作为硫源能够在路易斯酸比如 AlCl_3 或 FeCl_3 存在下使用。化合物4与硫源的反应一般在溶剂中进行，适宜溶剂是例如氯化的烷烃比如二氯甲烷或氯仿，和芳族溶剂比如苯、甲苯、各种二甲苯、氯苯或二氯苯。反应温度能够在宽范围变化，比如 -78°C 至室温。通常，将化合物4溶于溶剂，任选冷却，然后加入碱(如果使用)和随后硫源。化合物4能够另选地与硫源反应，其提供化合物3，其在硫醇基团SH被保护基团保护(S-PG)。这是有

利的,条件是化合物3例如将经受较剧烈的纯化条件或进行衍生化,例如将前体基团A'转化为基团A或在该阶段修饰基团A'。此外,受保护产物的纯化是更容易的。提供这种受保护硫醇的适宜硫化剂是例如硫脲($\text{NH}_2\text{-C(=S)-NH}_2$),任选经取代的硫醇,比如苄基硫醇,邻-或对-甲氧基-苄基硫醇,邻-或对-羟基苄基硫醇,邻-或对-乙酰氧基苄基硫醇,邻-或对-硝基苄基硫醇或2,4,6-三甲基苄基硫醇,吡啶-4-基-甲硫醇,喹啉-2-基-甲硫醇,苄基金属硫化物,比如苄基硫化钠,苯硫醇,2,4-二硝基苯硫醇,三苯甲基硫醇,叔丁硫醇,式 $\text{R-C(=O)-NH-CH}_3\text{-SH}$ 化合物,其中R是甲基、叔丁基、烯丙基、苯基或苄基,2-三甲基甲硅烷基-乙硫醇,2-(2,4-二硝基苯基)-乙硫醇,2-苯基磺酰基-乙硫醇,酰化的硫醇比如甲基羰基硫醇或苯基羰基硫醇,和硫代氨基甲酸苄酯 R-NH-C(=O)-SH ,其中R是例如甲基或乙基。苄基硫醇和烷基硫醇一般在碱存在下使用,所述碱是比如氢氧化钠,氢氧化钾,磷酸钠,磷酸钾,磷酸氢钠,磷酸氢钾,碳酸钠,碳酸钾,碳酸铯,氢化钠,氢化钾,二异丙基氨基锂(LDA),甲醇钠,乙醇钠,叔丁醇钾,含水四硼酸钠,正丁基锂,叔丁基锂,四丁基铵氟化物(TBAF),NaHMDS等;或在路易斯或质子酸存在下使用,所述路易斯或质子酸是比如 FeCl_3 , $\text{Zn(ClO}_4)_2$, $\text{Cu(BF}_4)_2$, HBF_4 或 HClO_4 。反应一般在溶剂中进行,适宜溶剂是例如氯化的烷烃比如二氯甲烷或氯仿,和醚比如二乙醚,二丙基醚,甲基叔丁基醚,甲基异丁基醚,乙二醇二甲基醚,四氢呋喃(THF)或二噁烷等。反应温度能够在宽范围变化,比如 -25°C 至反应混合物沸点。酰化的硫醇能够纯净地反应或在溶剂中反应,适宜溶剂是例如氯化的烷烃比如二氯甲烷或氯仿,和醚比如二乙醚,二丙基醚,甲基叔丁基醚,甲基异丁基醚,乙二醇二甲基醚,四氢呋喃(THF)或二噁烷等。它们能够与或不与碱一起使用。然后,S-保护的化合物3能够在对各保护基团一般已知的条件下脱保护为游离硫醇3,比如描述于例如Peter G.M.Wuts, Theodora Greene, *Protective Groups in Organic Synthesis*, 4th edition, John Wiley&Sons, Inc., 2007, Chapter 6。

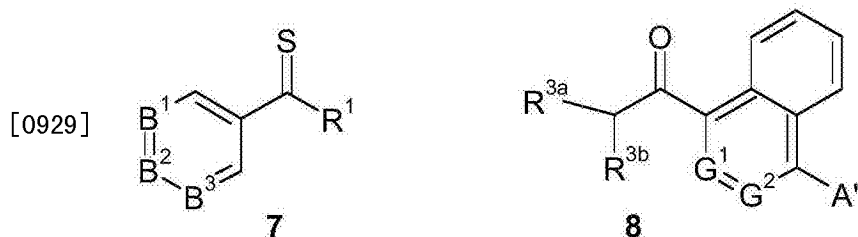
[0924] 化合物4能够类似于EP-A-2172462中描述的方法地制备。

[0925] 化合物1(其中 R^{3b} 不一定是氢)能够另选地制备如下:将式6化合物与胺化剂反应,形成式5化合物,其自发地反应为化合物1,如方案3中所示。反应能够类似于化合物3和2地进行。

[0926] 方案3

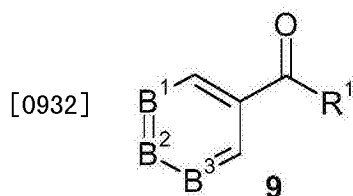


[0928] 式6化合物能够获得如下:将式7化合物与式8化合物反应。



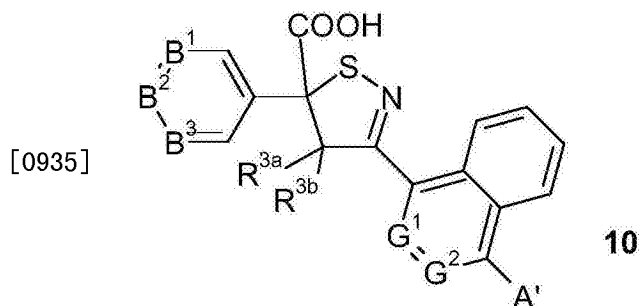
[0930] 反应优选作为Mukaiyama醛醇反应进行。出于该意图,将8的三烷基甲硅烷基-烯醇化物衍生物与7在路易斯酸比如TiCl₄或BF₃[O(C₂H₅)₂]存在下反应。另选地,反应能够在强碱比如二异丙基氨基锂(LDA),二(三甲基)甲硅烷基胺基钠(六甲基二硅基氨基钠;NaHMDS)和胺比如三乙胺、三丙胺或二异丙基乙胺存在下进行。反应一般在溶剂中进行。如果使用锂或钠碱,则溶剂适宜地是醚比如二乙醚,二丙基醚,甲基叔丁基醚,甲基异丁基醚,乙二醇二甲基醚,四氢呋喃(THF)或二噁烷等。适宜反应温度的范围是-78至25℃。如果使用胺碱,则溶剂适宜地是醚比如二乙醚,二丙基醚,甲基叔丁基醚,甲基异丁基醚,乙二醇二甲基醚,四氢呋喃(THF)或二噁烷,或者烷烃比如戊烷,己烷或庚烷。适宜反应温度的范围是25至100℃。

[0931] 式7化合物能够获得如下:将式9化合物与硫化剂比如Lawesson试剂或P₂S₅反应。



[0933] 反应一般在溶剂中进行,适宜溶剂是例如芳族溶剂比如苯,甲苯,各种二甲苯,氯苯或二氯苯,醚比如二乙醚,二丙基醚,甲基叔丁基醚,甲基异丁基醚,乙二醇二甲基醚,四氢呋喃(THF)或二噁烷,和六甲基磷酸三酰胺(HMPA)。反应一般在25℃至反应混合物沸点的温度进行。

[0934] 式I化合物,其中R¹是CF₃,能够此外制备如下:将式10化合物与氟化剂反应,和如果必需(也即如果A'是A的前体)则将基团A'转化为基团A。

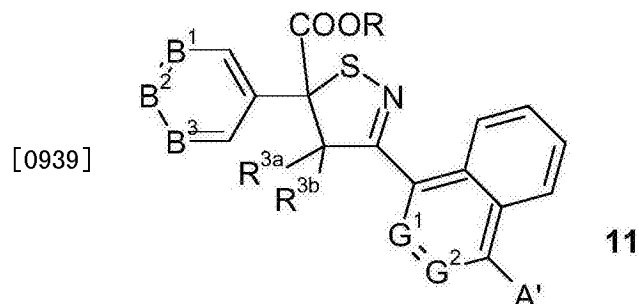


[0936] 适宜的氟化剂例如SF₄,优选与HF或BF₃[O(C₂H₅)₂]组合,苯基硫三氟化物(Ph-SF₃),优选与HF和吡啶组合,4-叔丁基-2,6-二甲基苯基硫三氟化物("Fluolod"),和二(2-甲氧基乙基)氨基硫三氟化物[(CH₃OCH₂CH₂)₂NSF₃]。在这些当中,优选与HF组合的SF₄。如果使用与HF组合的SF₄,则反应纯净地进行,也即不使用任何其它溶剂。反应一般在源自反应物的升高的压力下进行,例如2至10巴、优选5至8巴的压力。反应温度能够在宽范围变化,比如25至120℃,优选60至100℃。

[0937] 另选地,氟化能够通过2步方法进行,其中异噻唑啉环上的羧基首先转化为CCl₃基

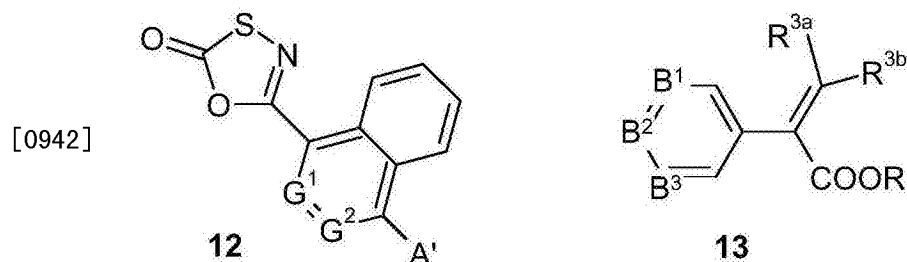
团,随后将其氟化为 CF_3 基团。 COOH 基团向 CCl_3 基团的转化优选进行如下:将化合物VI与 PCl_5 和苯基-膦氧基二氯化物(Ph-P(=O)Cl_2)反应。反应能够纯净地进行,也即不使用任何其它溶剂。适宜地,反应在升高的温度进行,例如 50°C 至回流和优选回流。用于将 CCl_3 基团转化为 CF_3 基团的氟化剂是上文提及的那些,并且还是 HF 和与 SbCl_5 组合的 HF 和与 Cl_2 和 SbF_3 组合的 HF 。反应能够纯净地进行,也即不使用任何其它溶剂。反应温度能够在宽范围变化,例如 25 至 300°C ,优选 50 至 200°C 和尤其是 80 至 120°C 。如果氟化剂是 HF 或与其它试剂组合的 HF ,则反应一般在源自 HF 的压力发生,所述压力一般是 2 至 10 巴,优选 5 至 8 巴。

[0938] 式10化合物优选获得如下:水解式11化合物,其中 R 是 C_1 - C_4 -烷基。



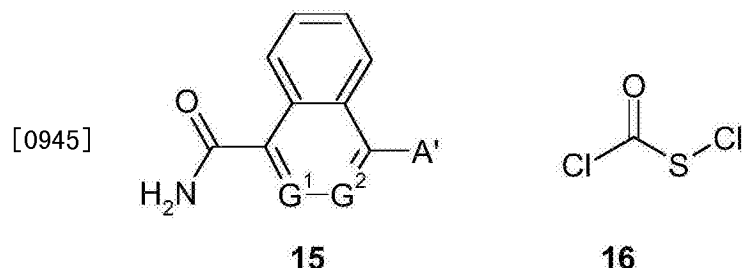
[0940] 水解能够通过已知水解酯基团的任何适宜手段进行,比如酸性条件,例如用盐酸,氢溴酸,硫酸,三氟乙酸等,或碱性条件,例如用碱金属氢氧化物比如 LiOH 、 NaOH 或 KOH ,或碱金属碳酸盐比如碳酸钠或碳酸钾。

[0941] 式11化合物能够又获得如下:将化合物12与化合物13反应



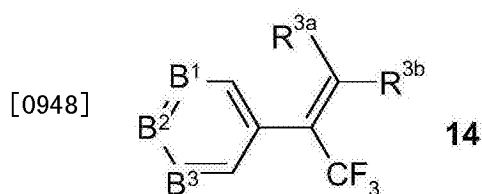
[0943] 反应在升高的温度进行,例如 90 至 200°C ,优选 100 至 180°C 和尤其是 120 至 160°C ,例如约 140°C 。

[0944] 式12化合物能够又获得如下:将化合物15与化合物16反应



[0946] 反应一般在溶剂中进行,适宜溶剂是例如芳族溶剂比如苯,甲苯,各种二甲苯,氯苯和二氯苯。反应温度优选是 80 至 140°C ,更优选 100 至 120°C 。

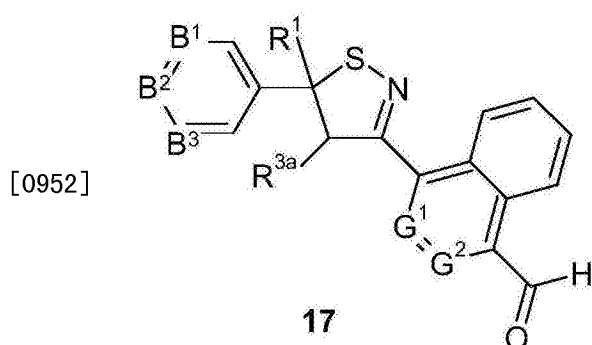
[0947] 然而其中 R^1 是 CF_3 的式I化合物能够此外制备如下:将如前文所定义的式12化合物与式14化合物反应,和如果必需,则将基团 A' 转化为基团 A 。



[0949] 反应在升高的温度进行,例如90至200℃,优选100至180℃和尤其是120至160℃,例如约140℃。

[0950] 化合物I',其中A'是A的前体,能够如下所示地转化为不同的基团A¹至A³。

[0951] 化合物I',其中A'是Cl、Br、I或-OSO₂-R^{z1},其中R^{z1}是如前文所定义,能够转化为化合物I,其中A是基团A¹,其中A¹是亚氨基-C(=NR⁶)R⁸:在过渡金属配合物催化剂、优选铯催化剂存在下,与一氧化碳和氢化物来源比如三乙基硅烷反应,形成羰基化合物17。该反应将初始基团A'转化为羰基-C(=O)H。

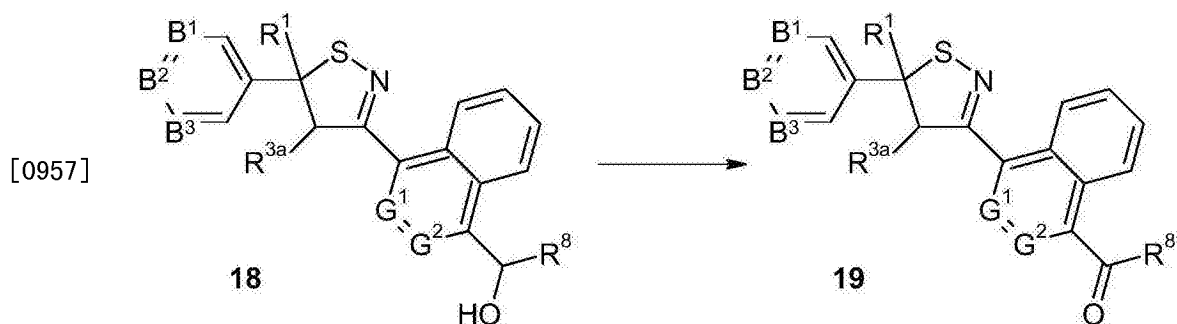


[0953] 醛17还能够获得如下:用氢化二异丁基铝(DIBAL-H)还原酯20(参见下文;R=C₁-C₄-烷基),直接形成醛17或者经由相应醇,然后将其氧化为醛。

[0954] 为了获得化合物,其中亚氨基中的R⁸是H,然后将所述羰基化合物17与胺(衍生物)NH₂R⁶反应。另选地,化合物I',其中A'是Cl、Br、I或-OSO₂-R^{z1},其中R^{z1}是如前文所定义,能够在过渡金属配合物催化剂和胺NH₂R⁶存在下、在一锅反应中与一氧化碳和氢反应。

[0955] 为了获得化合物,其中亚氨基中的R⁸不是H,将羰基化合物与格氏试剂R⁸-MgHal,其中Hal是Cl、Br或I,或有机锂化合物R⁸-Li反应,获得式18醇,然后将其氧化为式19羰基化合物,如方案4中所示。然后,将其与胺NH₂R⁶反应,形成各自的亚胺化合物。

[0956] 方案4



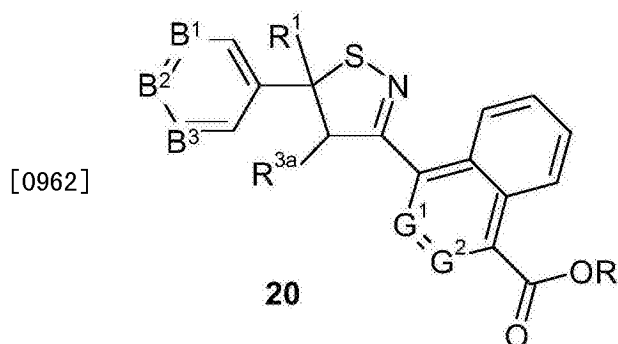
[0958] 这些反应能够类似于PCT/EP 2011/060388中或W0 2010/072781和其中所引用的参考文献、特别是W0 2006135763, Fattorusso et al, J. Med. Chem. 2008, 51, 1333-1343和W0 2008/122375中描述的方法进行。

[0959] 化合物I,其中A是基团A¹,其中A¹是-S(O)_nR⁹或-N(R⁵)R⁶,能够例如制备如下:在Cu

(I) 催化剂存在下, 在Ullmann-类型反应中将化合物I', 其中A'是Cl、Br或I与胺 NHR^5R^6 或硫醇 SHR^9 反应。为了获得化合物, 其中A¹是 $-\text{S}(\text{O})_n\text{R}^9$, 其中n不是0, 能够然后例如用过氧化氢氧化硫醇。胺和硫醇基团能够在Buchwald-Hartwig反应中进一步引入: 在钯催化剂比如 $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$ 存在下, 在碱比如碳酸铯或N,N-二异丙基乙基胺存在下, 和任选在膦配体比如Xantphos("4,5-二(二苯基膦基)-9,9-二甲基咕吨")存在下, 将化合物I', 其中A'是Cl、Br或I, 与胺 NHR^5R^6 或硫醇 HSR^9 反应。

[0960] 硫醚(A¹= $-\text{SR}^9$)能够进一步引入: 在碱比如碳酸钾(K_2CO_3)存在下, 在 $\text{S}_\text{N}\text{Ar}$ 反应(亲核芳族取代反应)中将化合物I', 其中A'是F, 与硫醇 HSR^9 反应, 或与硫醇盐(例如 NaSR^9)反应。

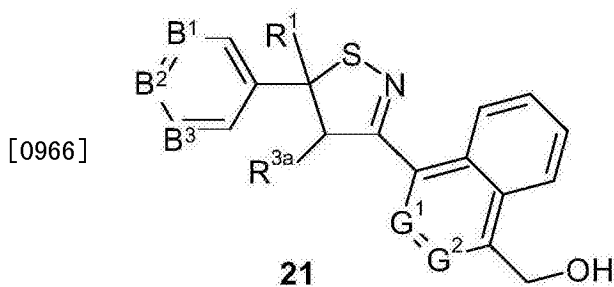
[0961] 化合物I, 其中A是基团A², 其中W是O, 能够制备如下: 在钯催化剂和醇 ROH , 其中R是 C_1 - C_4 -烷基存在下, 将化合物I', 其中A'是Cl、Br、I或三氟甲磺酸酯, 与一氧化碳反应, 形成式20化合物。适宜的钯催化剂是例如描述于PCT/EP 2011/060388的那些。



[0963] 然后, 将该酯水解为各自的羧酸, 将其在标准酰胺化条件下与胺 $\text{NHR}^5\text{R}^{6a}$ 反应。水解能够在标准条件下进行, 例如在酸性条件下用例如盐酸、硫酸或三氟乙酸, 或在碱性条件下用例如碱金属氢氧化物比如 LiOH 、 NaOH 或 KOH 。酰胺化优选进行如下: 用草酰氯 $[(\text{COCl})_2]$ 或亚硫酰氯(SOCl_2)将羧酸活化为各自的酰氯, 随后与胺 NHR^5R^6 反应。另选地, 酰胺化在偶联剂存在下进行。适宜的偶联剂(活化剂)是熟知并且例如选自碳二亚胺比如DCC(二环己基碳二亚胺)和DCI(二异丙基碳二亚胺), 苯并三唑衍生物比如HATU(0-(7-氮杂苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲鎓六氟磷酸盐)、HBTU((0-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲鎓六氟磷酸盐)和HCTU(1H-苯并三唑鎓-1-[二(二甲基氨基)亚甲基]-5-氯四氟硼酸盐), 和磷衍生的活化剂比如BOP((苯并三唑-1-基氧基)-三(二甲基氨基)磷六氟磷酸盐)、Py-BOP((苯并三唑-1-基氧基)-三吡咯烷磷六氟磷酸盐)和Py-BrOP(溴三吡咯烷磷六氟磷酸盐)。一般地, 活化剂过量地使用。苯并三唑和磷偶联剂一般在碱性介质中使用。

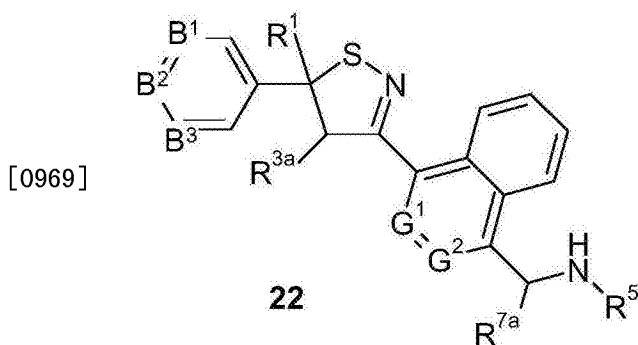
[0964] 化合物I, 其中A是基团A², 其中W是S, 能够制备如下: 将相应的氧化合物(W是O)与Lawesson试剂(CAS 19172-47-5)反应, 参见例如Jesberger等人, *Synthesis*, 2003, 1929-1958及其参考文献。溶剂比如HMPA或THF能够在升高的温度比如60°C至100°C使用。优选的反应条件是THF、在65°C。

[0965] 化合物I, 其中A是基团A³, 其中 R^{7a} 和 R^{7b} 是氢, 能够制备如下: 用例如LAH(氢化铝锂)或DIBAL-H(二异丁基铝氢化物)还原化合物20或17, 形成化合物21。

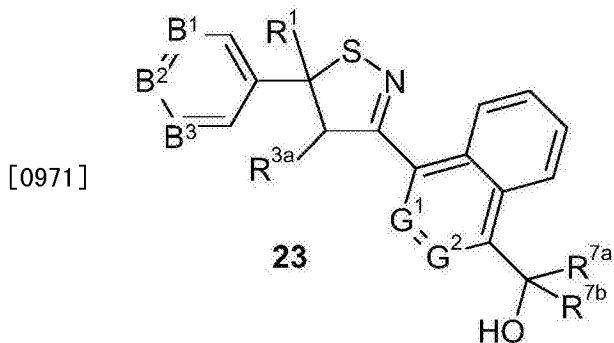


[0967] 然后, 将其在 S_N 反应中与胺 NHR^5R^6 反应。出于该意图, OH基团能够首先转化为更佳的离去基团, 例如磺酸酯(例如甲磺酸酯, 甲苯磺酸酯或三氟甲磺酸酯基团)。如果 R^6 是基团 $-C(O)R^8$, 则另选地可能的是将化合物21与胺 NH_2R^5 反应, 和然后将所得苄型胺与酸 R^8-COOH 或其衍生物比如其酰氯 R^8-COCl 在酰胺化反应中反应。

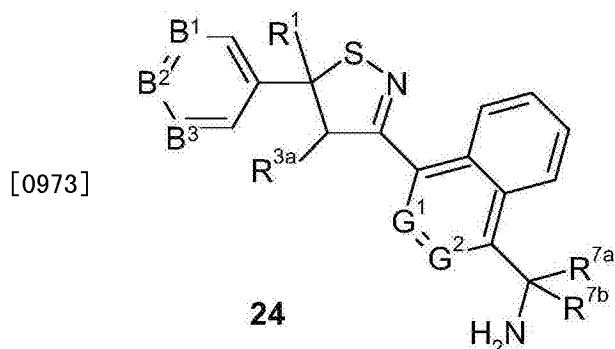
[0968] 化合物I, 其中A是基团 A^3 , 其中 R^{7a} 是任选经取代的烷基或任选经取代的环烷基和 R^{7b} 是氢, 能够制备如下: 对酮19, 其中 R^8 相应于 R^{7a} , 其是任选经取代的 C_1-C_6 -烷基或任选经取代的 C_3-C_8 -环烷基, 进行还原胺化, 提供化合物22。还原胺化的典型条件是: 将酮19与胺 H_2NR^5 反应, 产生相应亚胺, 用还原剂比如 $Na(CN)BH_3$ 将其还原为胺22。从酮19至胺22的反应还可以按一锅程序进行。



[0970] 为了获得化合物, 其中 R^{7a} 和 R^{7b} 是任选经取代的烷基、任选经取代的环烷基、任选经取代的烯基或任选经取代的炔基, 将羰基化合物比如19, 其中 R^8 相应于 R^{7a} , 其是任选经取代的 C_1-C_6 -烷基、任选经取代的 C_3-C_8 -环烷基、任选经取代的 C_2-C_6 -烯基或任选经取代的 C_2-C_6 -炔基, 与格氏试剂 $R^{7b}-MgHal$, 其中Hal是Cl、Br或I, 与或有机锂化合物 $R^{7b}-Li$, 其中 R^{7b} 是任选经取代的 C_1-C_6 -烷基、任选经取代的 C_3-C_8 -环烷基、任选经取代的 C_2-C_6 -烯基或任选经取代的 C_2-C_6 -炔基, 进行反应, 获得式23醇。

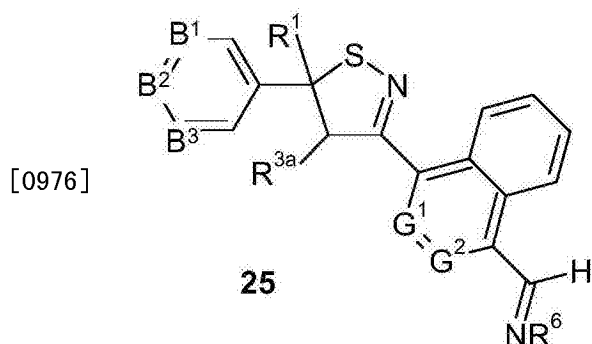


[0972] 然后, 醇23能够经由相应叠氮化物转化为胺24, 如例如Organic Letters, 2001, 3 (20), 3145-3148的描述。



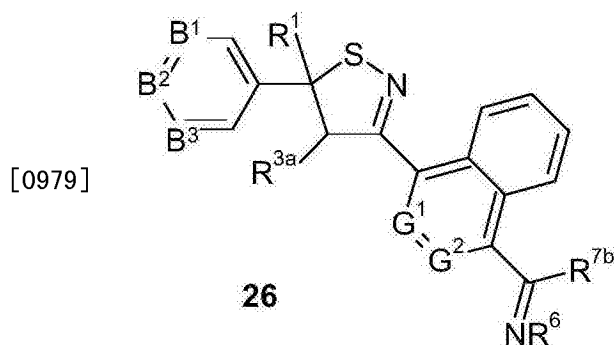
[0974] 如果希望,能够例如借助标准烷基化或酰化反应将其转化为化合物I,其中 R^5 和 R^6 是不同于氢。

[0975] 化合物I,其中A是基团 A^3 ,其中 R^{7a} 是任选经取代的烷基、烯基、炔基、环烷基或CN和 R^{7b} 是氢,能够制备如下:通过与胺衍生物 NH_2R^6 反应将醛17转化为亚胺25,其中 R^6 是亚磺酰基,或者为了制备 $R^{7a}=CN$ 的化合物,是甲苯磺酸叔丁酯。



[0977] 然后,将该亚胺与化合物 $H-R^{7a}$ 在加成反应中反应,其条件参考例如J. Am. Chem. Soc. 2009, 3850-3851及其中引用的参考文献的描述,或为了引入CN充当基团 R^{7a} ,则参考Chemistry-A European Journal 2009, 15, 11642-11659。

[0978] 化合物I,其中A是基团 A^3 ,其中 R^{7a} 和 R^{7b} 均是任选经取代的烷基、烯基、炔基、环烷基或CN,能够类似地制备如下:通过与胺衍生物 NH_2R^6 反应(其中 R^6 是亚磺酰基,或者为了制备 $R^{7a}=CN$ 的化合物26,是甲苯磺酸叔丁酯),将酮19,其中 R^8 具有对 R^{7b} 希望的含义并且是任选经取代的烷基、烯基、炔基、环烷基或CN,转化为亚胺。



[0980] 然后,将该亚胺与化合物 $H-R^{7a}$ 在加成反应中反应,其条件如例如J. Org. Chem 2002, 67, 7819-7832及其中所引用的参考文献的描述,或者为了引入CN充当基团 R^{7a} ,例如Chemistry-A European Journal 2009, 15, 11642-11659。如果希望,能够然后除去 R^6 ,产生氨基 NH_2 。

[0981] 一般来说,式(I)化合物包括它们的立体异构体、盐和N-氧化物,并且它们在合成过程中的前体能够通过上述方法制备。如果单独的化合物不能经由上述途径制备,则它们能够制备如下:衍生化其它化合物(I)或各自的前体,或者常规修饰所描述的合成途径。例如,在单独的情况下,某些式(I)化合物能够有利地如下制备自其它式(I)化合物:衍生化例如酯水解、酰胺化、酯化、醚裂解、烯化、还原、氧化等,或常规修饰所描述的合成途径。

[0982] 反应混合物以常规方式后处理,例如与水混合,分相,和如果适当则通过色谱法例如在氧化铝或在硅胶上纯化粗制产物。某些中间体和终产物可以以无色或淡褐色粘稠油状物的形式获得,其不含或已纯化除去在减压和在适度升高的温度下的挥发性组分。如果中间体和终产物作为固体获得,它们可以通过重结晶或研制来纯化。

[0983] 由于其优异活性,本发明化合物可以用于防治无脊椎动物病虫害。

[0984] 相应地,本发明也提供防治无脊椎病虫害的方法,该方法包括将病虫害、其食物来源、其生境或其育种地,或栽培植物、植物繁殖材料(比如种子),土壤,区域,物质或病虫害生长或可以生长的环境,或待保护以免受病虫害侵袭或侵染的物质、栽培植物、植物繁殖材料(比如种子)、土壤、表面或空间用农药有效量的本发明化合物或上文定义的组合物。本发明也涉及本发明化合物、立体异构体和/或农业上或其兽医上可接受的盐用于抗击无脊椎动物病虫害的用途。

[0985] 优选,本发明方法用于保护植物繁殖材料(比如种子)和自其生长的植物免于无脊椎动物病虫害侵袭或侵染,和包括用农药有效量的如前文所定义的本发明化合物或用农药有效量的如上下文所定义的农业组合物处理植物繁殖材料(比如种子)。本发明方法并不局限于保护已根据本发明处理的“基底”(植物、植物繁殖材料、土壤物质等),而是还具有预防性效果,从而,例如保护自经处理的植物繁殖材料(比如种子)生长的植物,植物本身并未经过处理。

[0986] 另外优选,本发明方法用于保护植物免受无脊椎动物病虫害侵袭或侵染,该方法包括用农药有效量的至少一种本发明化合物、其立体异构体和/或至少一种其农业上可接受的盐处理植物。

[0987] 在本发明的意义中,“无脊椎动物病虫害”优选选自节肢动物和线虫,更优选有害的昆虫、蛛形动物和线虫,和甚至更优选昆虫、螨类和线虫。在本发明的意义中,“无脊椎动物病虫害”最优选是昆虫。

[0988] 本发明还提供用于抗击无脊椎动物病虫害的农业组合物,其包含具有农药作用的量的至少一种根据本发明的化合物和至少一种惰性液态和/或固态的农学上可接受的载体,和如果希望至少一种表面活性剂。

[0989] 上述组合物可以包含单一的本发明活性化合物或数本发明活性化合物的混合物。根据本发明的组合物可以包含单独的异构体或异构体的混合物或盐以及单独的互变异构体或互变异构体的混合物。

[0990] 本发明化合物,包括它们的盐、立体异构体和互变异构体,尤其适于有效防治节肢动物病虫害比如蛛形动物、千足虫(myriapedes)和昆虫以及线虫。它们特别适于有效地抗击或防治下述病虫害:

[0991] 鳞翅目昆虫(鳞翅目(Lepidoptera)),例如桑剑纹夜蛾(*Acronicta major*), *Adoxophyes orana*, 烦夜蛾(*Aedia leucomelas*), 地夜蛾属(*Agrotis* spp.) 比如 *Agrotis*

fucosa,黄地老虎(*Agrotis segetum*),*Agrotis ypsilon*;Alabama argillacea,大豆夜蛾(*Anticarsia gemmatalis*),干煞夜蛾属(*Anticarsia* spp.),苹果银蛾(*Argyresthia conjugella*),*Autographa gamma*,甘蓝夜蛾(*Barathra brassicae*),*Bucculatrix thurberiella*,松粉蝶尺蛾(*Bupalus piniarius*),*Cacoecia murinana*,黄尾卷叶蛾(*Cacoecia podana*),*Capua reticulana*,苹果小卷蛾(*Carpocapsa pomonella*),果园秋尺蛾(*Cheimatobia brumata*),禾草螟属(*Chilo* spp.)比如二化螟(*Chilo suppressalis*);云杉色卷蛾(*Choristoneura fumiferana*),西部云杉色卷蛾(*Choristoneura occidentalis*),白点粘虫(*Cirphis unipuncta*),葡萄果蠹蛾(*Clysia ambiguella*),*Cnaphalocerus* spp.,苹果皮小卷蛾(*Cydia pomonella*),*Dendrolimus pini*,*Diaphania nitidalis*,*Diatraea grandiosella*,埃及钻夜蛾(*Earias insulana*),南美玉米苗斑螟(*Elasmopalpus lignosellus*),粉斑螟(*Ephestia cautella*),地中海粉斑螟(*Ephestia kuehniella*),女贞细卷蛾(*Eupoecilia ambiguella*),黄毒蛾(*Euproctis chrysorrhoea*),切夜蛾属(*Euxoa* spp.),欧松梢小卷蛾(*Evetria bouliana*),*Feltia* spp.比如粒肤脏切夜蛾(*Feltia subterranean*);蜡螟(*Galleria mellonella*),李小食心虫(*Grapholitha funebrana*),梨小食心虫(*Grapholitha molesta*),*Helicoverpa* spp.比如美洲棉铃虫(*Helicoverpa armigera*),谷实夜蛾(*Helicoverpa zea*);实夜蛾属(*Heliothis* spp.)比如棉铃虫(*Heliothis armigera*),烟芽夜蛾(*Heliothis virescens*),*Heliothis zea*;菜心野螟(*Hellula undalis*),*Hibernia defoliaria*,褐织蛾(*Hofmannophila pseudospretella*),茶长卷蛾(*Homona magnanima*),美国白蛾(*Hyphantria cunea*),苹果巢蛾(*Hyponomeuta padella*),小苹果巢蛾(*Hyponomeuta malinellus*),番茄茎麦蛾(*Keiferia lycopersicella*),铁杉尺蛾(*Lambdina fiscellaria*),贪夜蛾属(*Laphygma* spp.)比如*Laphygma exigua*;Leucoptera coffeella,旋纹潜蛾(*Leucoptera scitella*),苹果金纹细蛾(*Lithocolletis blancardella*),绿果冬夜蛾(*Lithophane antennata*),鲜食葡萄小卷蛾(*Lobesia botrana*),*Loxagrotis albicosta*,网锥额野螟(*Loxostege sticticalis*),毒蛾属(*Lymantria* spp.)比如舞毒蛾(*Lymantria dispar*),模毒蛾(*Lymantria monacha*);桃潜叶蛾(*Lyonetia clerkella*),黄褐天幕毛虫(*Malacosoma neustria*),甘蓝夜蛾属(*Mamestra* spp.)比如甘蓝夜蛾(*Mamestra brassicae*);*Mocis repanda*,*Mythimna separata*,黄杉合毒蛾(*Orgyia pseudotsugata*),*Oria* spp.,秆野螟属(*Ostrinia* spp.)比如欧洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis*);水稻负泥虫(*Oulema oryzae*),小眼夜蛾(*Panolis flammea*),红铃虫属(*Pectinophora* spp.)比如棉红铃虫(*Pectinophora gossypiella*);疆夜蛾(*Peridroma saucia*),圆掌舟蛾(*Phalera bucephala*),麦蛾属(*Phthorimaea* spp.)比如马铃薯麦蛾(*Phthorimaea operculella*);柑橘叶潜蛾(*Phyllocnistis citrella*),粉蝶属(*Pieris* spp.)比如欧洲粉蝶(*Pieris brassicae*),菜粉蝶(*Pieris rapae*);苜蓿绿夜蛾(*Plathypena scabra*),菜蛾(*Plutella maculipennis*),小菜蛾(*Plutella xylostella*),斜纹夜蛾属(*Prodenia* spp.),伪碾夜蛾属(*Pseudaletia* spp.),大豆尺夜蛾(*Pseudoplusia includens*),玉米螟(*Pyrausta nubilalis*),美松梢小卷蛾(*Rhyacionia frustrana*),*Scrobipalpula absoluta*,麦蛾(*Sitotroga cerealella*),葡萄长须卷蛾(*Sparganothis pilleriana*),贪夜蛾属(*Spodoptera* spp.)比如草地夜蛾(*Spodoptera frugiperda*),棉贪夜蛾(*Spodoptera*

littoralis),斜纹贪夜蛾(*Spodoptera litura*);*Thaumtopoea pityocampa*,*Thermesia gemmatalis*,袋谷蛾(*Tinea pellionella*),幕谷蛾(*Tineola bisselliella*),栎绿卷蛾(*Tortrix viridana*),粉夜蛾属(*Trichoplusia* spp.)比如粉斑夜蛾(*Trichoplusia ni*);番茄斑潜蝇(*Tuta absoluta*),和云杉线小卷蛾(*Zeiraphera canadensis*),

[0992] 甲虫(鞘翅目(*Coleoptera*)),例如菜豆象(*Acanthoscehdes obtectus*),喙丽金龟属(*Adoretus* spp.),蓝毛臀萤叶甲(*Agelastica alni*),梨窄吉丁(*Agrilus sinuatus*),叩甲属(*Agriotes* spp.)比如细胸叩头虫(*Agriotes fuscicollis*),直条叩甲(*Agriotes lineatus*),暗叩甲(*Agriotes obscurus*);*Amphimallus solstitialis*,北方材小蠹(*Anisandrus dispar*),家具窃蠹(*Anobium punctatum*),多色异丽金龟(*Anomala rufocuprea*),星天牛属(*Anoplophora* spp.)比如光肩星天牛(*Anoplophora glabripennis*);花象属(*Anthonomus* spp.)比如棉铃象(*Anthonomus grandis*),伞花象(*Anthonomus pomorum*);圆皮蠹属(*Anthrenus* spp.),*Aphthona euphoridae*,阿鳃金龟属(*Apogonia* spp.),*Athous haemorrhoidalis*,隐食甲属(*Atomaria* spp.)比如甜菜隐食甲(*Atomaria linearis*);毛皮蠹属(*Attagenus* spp.),黄守瓜(*Aulacophora femoralis*),纵坑切梢小蠹(*Blastophagus piniperda*),*Blitophaga undata*,*Bruchidius obtectus*,豆象属(*Bruchus* spp.)比如*Bruchus lentis*,豌豆象(*Bruchus pisorum*),蚕豆象(*Bruchus rufimanus*);桦绿卷象(*Byctiscus betulae*),绿豆象(*Callosobruchus chinensis*),甜菜大龟甲(*Cassida nebulosa*),菜豆萤叶甲(*Cerotoma trifurcata*),金花金龟(*Cetonia aurata*),龟象属(*Ceuthorhynchus* spp.)比如白菜籽龟象(*Ceuthorrhynchus assimilis*),*Ceuthorrhynchus napi*;蚤凹胫跳甲(*Chaetocnema tibialis*),卑微橐象虫(*Cleonus mendicus*),宽胸叩甲属(*Conoderus* spp.)比如烟草叩甲(*Conoderus vespertinus*);根颈象属(*Cosmopolites* spp.),褐新西兰肋翅鳃角金龟(*Costelytra zealandica*),石刁柏负泥虫(*Crioceris asparagi*),杨干隐喙象(*Cryptorhynchus lapathi*),*Ctenicera* spp.比如草原谷金针虫(*Ctenicera destructor*);象虫属(*Curculio* spp.),*Dectes texanus*,皮蠹属(*Dermestes* spp.),叶甲属(*Diabrotica* spp.)比如十二星叶甲(*Diabrotica 12-punctata*)*Diabrotica speciosa*,*Diabrotica longicornis*,*Diabrotica semipunctata*,*Diabrotica virgifera*;食植瓢虫属(*Epilachna* spp.)比如*Epilachna varivestis*,马铃薯瓢虫(*Epilachna vigintioctomaculata*);毛跳甲属(*Epitrix* spp.)比如烟草跳甲(*Epitrix hirtipennis*);巴西棉灰蒙象(*Eutinobothrus brasiliensis*),*Faustinus cubae*,裸蛛甲(*Gibbium psylloides*),黑异爪蔗金龟(*Heteronychus arator*),*Hylamorpha elegans*,欧洲松树皮象(*Hylobius abietis*),北美家天牛(*Hylotrupes bajulus*),埃及苜蓿叶象(*Hypera brunneipennis*),紫苜蓿叶象(*Hypera postica*),褐小蠹属(*Hypothenemus* spp.),云杉八齿小蠹(*Ips typographus*),甘蔗大褐齿爪鳃金龟(*Lachnosterna consanguinea*),烟草负泥虫(*Lema bilineata*),*Lema melanopus*,瘦跗叶甲属(*Leptinotarsa* spp.)比如马铃薯叶甲(*Leptinotarsa decemlineata*);甜菜叩甲(*Limonius californicus*),稻水象(*Lissorhoptrus oryzophilus*),稻水象(*Lissorhoptrus oryzophilus*),筒喙象属(*Lixus* spp.),粉蠹属(*Lyctus* spp.)比如褐粉蠹(*Lyctus bruneus*);*Melanotus communis*,菜花露尾甲属(*Meligethes* spp.)比如*Meligethes aeneus*;大栗鳃金龟(*Melolontha hippocastani*),五月鳃金龟(*Melolontha*

melolontha), Migdolus spp., 墨天牛属(Monochamus spp.) 比如松墨天牛(Monochamus alternatus); Naupactus xanthographus, 黄蛛甲(Niptus hololeucus), 椰蛀犀金龟(Oryctes rhinoceros), 锯谷盗(Oryzaephilus surinamensis), 黑葡萄耳象(Otiorrhynchus sulcatus), 草莓根耳象(Otiorrhynchus ovatus), 黑葡萄耳象(Otiorrhynchus sulcatus), 水稻负泥虫(Oulema oryzae), 小青花金龟(Oxycetonia jucunda), 辣根猿叶甲(Phaedon cochleariae), 梨树叶象(Phyllobius pyri), 庭园发丽金龟(Phyllopertha horticola), 食叶鳃金龟属(Phyllophaga spp.), 菜跳甲属(Phyllotreta spp.) 比如Phyllotreta chrysocephala, 绿胸菜跳甲(Phyllotreta nemorum), 黄曲条菜跳甲(Phyllotreta striolata); 食叶鳃金龟属(Phyllophaga spp.), 庭园发丽金龟(Phyllopertha horticola), 日本弧丽金龟(Popillia japonica), Premnotrypes spp., 油菜金头跳甲(Psylliodes chrysocephala), 蛛甲属(Ptinus spp.), 暗色瓢虫(Rhizobius ventralis), 谷蠹(Rhizopertha dominica), 直条根瘤象(Sitona lineatus), 米象属(Sitophilus spp.) 比如谷象(Sitophilus granaria), 玉米象(Sitophilus zeamais); 尖隐喙象属(Sphenophorus spp.) 比如Sphenophorus levis; 茎干象属(Sternechus spp.) 比如Sternechus subsignatus; 综合目(Symphyletes spp.), 黄粉甲(Tenebrio molitor), 拟谷盗属(Tribolium spp.) 比如赤拟谷盗(Tribolium castaneum); 斑皮蠹属(Trogoderma spp.), 籽象属(Tychius spp.), 脊虎天牛属(Xylotrechus spp.), 和距步甲属(Zabrus spp.) 比如玉米距步甲(Zabrus tenebrioides),

[0993] 蝇, 蚊(双翅目(Diptera)), 例如伊蚊属(Aedes spp.) 比如埃及伊蚊(Aedes aegypti), 白条伊蚊(Aedes albopictus), 刺扰伊蚊(Aedes vexans); 墨西哥按实蝇(Anastrepha ludens), 按蚊属(Anopheles spp.) 比如Anopheles albimanus, Anopheles crucians, Anopheles freeborni, 冈比亚按蚊(Anopheles gambiae), Anopheles leucosphyrus, 五斑按蚊(Anopheles maculipennis), 微小按蚊(Anopheles minimus), 四斑按蚊(Anopheles quadrimaculatus), 中华按蚊(Anopheles sinensis); 花园毛蚊(Bibio hortulanus), 丽蝇属(Calliphora erythrocephala), 红头丽蝇(Calliphora vicina), Cerafitis capitata, 地中海实蝇(Ceratitidis capitata), 金蝇属(Chrysomyia spp.) 比如蛆症金蝇(Chrysomya bezziana), Chrysomya hominivorax, Chrysomya macellaria; Chrysops atlanticus, Chrysops discalis, Chrysops silacea, 锥蝇属(Cochliomyia spp.) 比如嗜人锥蝇(Cochliomyia hominivorax); 康癭蚊属(Contarinia spp.) 比如高粱康癭蚊(Contarinia sorghicola); 噬人瘤蝇(Cordylobia anthropophaga), 库蚊属(Culex spp.) 比如Culex nigripalpus, 尖音库蚊(Culex pipiens), 致倦库蚊(Culex quinquefasciatus), Culex tarsalis, 三带喙库蚊(Culex tritaeniorhynchus); Culicoides furens, Culiseta inornata, Culiseta melanura, 黄蝇属(Cuterebra spp.), 瓜寡鬃实蝇(Dacus cucurbitae), 油橄榄果实蝇(Dacus oleae), 油菜叶癭蚊(Dasineura brassicae), 地种蝇属(Delia spp.) 比如葱地种蝇(Delia antique), 麦地种蝇(Delia coarctata), 灰地种蝇(Delia platura), 甘蓝地种蝇(Delia radicum); 人肤蝇(Dermatobia hominis), 果蝇属(Drosophila spp.), 厕蝇属(Fannia spp.) 比如夏厕蝇(Fannia canicularis); Gastraphilus spp. 比如肠胃蝇(Gasterophilus intestinalis);

三点尺禾蝇(*Geomyza tripunctata*),棕足舌蝇(*Glossina fuscipes*),刺舌蝇(*Glossina morsitans*),须舌蝇(*Glossina palpalis*),拟寄舌蝇(*Glossina tachinoides*),西方角蝇(*Haematobia irritans*),鞍瘿蚊(*Haplodiplosis equestris*),*Hippelates* spp.,黑蝇属(*Hylemyia* spp.)比如灰地种蝇(*Hylemyia platura*);皮蝇属(*Hypoderma* spp.)比如*Hypoderma lineata*;虱蝇属(*Hyppobosca* spp.),*Leptoconops torrens*,斑潜蝇属(*Liriomyza* spp.)比如蔬菜斑潜蝇(*Liriomyza sativae*),三叶草斑潜蝇(*Liriomyza trifolii*);绿蝇属(*Lucilia* spp.)比如*Lucilia caprina*,铜绿蝇(*Lucilia cuprina*),丝光绿蝇(*Lucilia sericata*);*Lycoria pectoralis*,*Mansonia titillanus*,*Mayetiola* spp.比如小麦瘿蚊(*Mayetiola destructor*);家蝇属(*Musca* spp.)比如秋家蝇(*Musca autumnalis*),家蝇(*Musca domestica*);厩腐蝇(*Muscina stabulans*),狂蝇属(*Oestrus* spp.)比如羊狂蝇(*Oestrus ovis*);禾蝇(*Opomyza florum*),麦杆蝇属(*Oscinella* spp.)比如*Oscinella frit*;波菜泉蝇(*Pegomya hysocyami*),银足白蛉(*Phlebotomus argentipes*),草种蝇属(*Phorbia* spp.)比如*Phorbia antiqua*,萝卜地种蝇(*Phorbia brassicae*),*Phorbia coarctata*; *Prosimulium mixtum*,胡萝卜茎蝇(*Psila rosae*),*Psorophora columbiae*,*Psorophora discolor*,樱桃绕实蝇(*Rhagoletis cerasi*),苹绕实蝇(*Rhagoletis pomonella*),麻蝇属(*Sarcophaga* spp.)比如赤尾麻蝇(*Sarcophaga haemorrhoidalis*);*Simulium vittatum*,螫蝇属(*Stomoxys* spp.)比如厩螫蝇(*Stomoxys calcitrans*);虻属(*Tabanus* spp.)比如*Tabanus atratus*,嗜牛虻(*Tabanus bovinus*),*Tabanus lineola*,*Tabanus similis*; *Tannia* spp.,*Tipula oleracea*,欧洲大蚊(*Tipula paludosa*),和污蝇属(*Wohlfahrtia* spp.),

[0994] 蓟马(缨翅目(*Thysanoptera*)),例如稻蓟马(*Baliothrips biformis*),*Dichromothrips corbetti*,*Dichromothrips* spp.,*Enneothrips flavens*,花蓟马属(*Frankliniella* spp.)比如*Frankliniella fusca*,西花蓟马(*Frankliniella occidentalis*),东方花蓟马(*Frankliniella tritici*);实夜蛾属(*Heliothrips* spp.),温室条蓟马(*Hercinothrips femoralis*),卡蓟马属(*Kakothrips* spp.),葡萄蓟马(*Rhipiphorothis cruentatus*),硬蓟马属(*Scirtothrips* spp.)比如*Scirtothrips citri*; *Taeniothrips cardamoni*,蓟马属(*Thrips* spp.)比如稻蓟马(*Thrips oryzae*),棕榈蓟马(*Thrips palmi*),烟蓟马(*Thrips tabaci*);

[0995] 白蚁(等翅目(*Isoptera*)),例如*Calotermes flavicollis*,台湾乳白蚁(*Coptotermes formosanus*),*Heterotermes aureus*,长头异白蚁(*Heterotermes longiceps*),*Heterotermes tenuis*,*Leucotermes flavipes*,土白蚁属(*Odontotermes* spp.),散白蚁属(*Reticulitermes* spp.)比如栖北散白蚁(*Reticulitermes speratus*),欧美散白蚁(*Reticulitermes flavipes*),*Reticulitermes grassei*,暗黑散白蚁(*Reticulitermes lucifugus*),桑特散白蚁(*Reticulitermes santonensis*),美小黑散白蚁(*Reticulitermes virginicus*);*Termes natalensis*,

[0996] 蟑螂(蜚蠊目(*Blattaria*)-蜚蠊目(*Blattodea*)),例如居屋艾蟋(*Acheta domesticus*),东方蜚蠊(*Blatta orientalis*),*Blattella asahinae*,德国小蠊(*Blattella germanica*),蝼蛄属(*Gryllotalpa* spp.),马德拉蜚蠊(*Leucophaea maderae*),飞蝗属(*Locusta* spp.),黑蝗属(*Melanoplus* spp.),美洲大蠊(*Periplaneta americana*),澳洲大

蠊(*Periplaneta australasiae*),褐斑大蠊(*Periplaneta brunnea*),黑胸大蠊(*Periplaneta fuliginosa*),日本大蠊(*Periplaneta japonica*),

[0997] 蝽虫,蚜虫,叶蝉,粉虱,蚧虫,蝉(半翅目(Hemiptera)),例如Acrosternum spp.比如拟绿蝽(*Acrosternum hilare*);无网长管蚜属(*Acyrtosiphon* spp.)比如Acyrtosiphon onobrychis,豌豆蚜(*Acyrtosiphon pisum*);落叶松球蚜(*Adelges laricis*),Aeneolamia spp.,Agonosцена spp.,粉虱属(*Aleurodes* spp.),蔗裂粉虱(*Aleurolobus barodensis*),粉虱属(*Aleurothrixus* spp.),杧果叶蝉属(*Amrasca* spp.),南瓜缘蝽(*Anasa tristis*),拟丽蝽属(*Antestiopsis* spp.),飞廉短尾蚜(*Anuraphis cardui*),肾圆盾蚧属(*Aonidiella* spp.),梨矮蚜(*Aphanostigma piri*),Aphidula nasturtii,蚜属(*Aphis* spp.)比如豆卫矛蚜(*Aphis fabae*),草莓根蚜(*Aphis forbesi*),棉蚜(*Aphis gossypii*),北美茶藨子蚜(*Aphis grossulariae*),苹果蚜(*Aphis pomi*),接骨木蚜(*Aphis sambuci*),希奈德蚜(*Aphis schneideri*),异绣线菊蚜(*Aphis spiraeicola*);葡萄叶蝉(*Arboridia apicalis*),齿背猎蝽(*Arilus critatus*),小圆盾蚧属(*Aspidiella* spp.),圆盾蚧属(*Aspidiotus* spp.),Atanus spp.,土豆沟无网蚜(*Aulacorthum solani*),粉虱属(*Bemisia* spp.)比如银叶粉虱(*Bemisia argentifolii*),甘薯粉虱(*Bemisia tabaci*);土长蝽属(*Blissus* spp.)比如美洲谷杆长蝽(*Blissus leucopterus*);飞廉短尾蚜(*Brachycaudus cardui*),李短尾蚜(*Brachycaudus helichrysi*),桃短尾蚜(*Brachycaudus persicae*),櫻桃短尾蚜(*Brachycaudus prunicola*),Brachycolus spp.,甘蓝蚜(*Brevicoryne brassicae*),小褐稻虱(*Calligypona marginata*),俊盲蝽属(*Calocoris* spp.),Campylomma livida,Capitophorus horni,Carneocephala fulgida,异背长蝽属(*Cavelerius* spp.),Ceraplastes spp.,甘蔗粉角蚜(*Ceratovacuna lanigera*),沫蝉科(Cercopidae),Cerosipha gossypii,草莓中瘤钉毛蚜(*Chaetosiphon fragaefolii*),Chionaspis tegalensis,茶绿叶蝉(*Chlorita onukii*),核桃黑斑蚜(*Chromaphis juglandicola*),褐圆盾蚧属(*Chrysomphalus ficus*),玉米叶蝉(*Cicadulina mbila*),臭虫属(*Cimex* spp.)比如热带臭虫(*Cimex hemipterus*),温带臭虫(*Cimex lectularius*);Cocco-mytilus halli,软蚧属(*Coccus* spp.),Creontiades dilutus,茶藨隐瘤蚜(*Cryptomyzus ribis*),茶藨隐瘤蚜(*Cryptomyzus ribis*),黑斑烟盲蝽(*Cyrtopeltis notatus*),Dalbulus spp.,Dasynus piperis,Dialeurades spp.,桔木虱属(*Diaphorina* spp.),白背盾蚧属(*Diaspis* spp.),Dichelops furcatus,胡椒网蝽(*Diconocoris hewetti*),Doralis spp.,高加索冷杉椎球蚜(*Dreyfusia nordmanniana*),云杉锥球蚜(*Dreyfusia piceae*),履绵蚧属(*Drosicha* spp.),西圆尾蚜属(*Dysaphis* spp.)比如车前西圆尾蚜(*Dysaphis plantaginea*),Dysaphis pyri,居根西圆尾蚜(*Dysaphis radicola*);Dysaulacorthum pseudosolani,棉红蝽属(*Dysdercus* spp.)比如棉红蝽(*Dysdercus cingulatus*),Dysdercus intermedius;灰粉蚧属(*Dysmicoccus* spp.),绿小叶蝉属(*Empoasca* spp.)比如蚕虫小绿叶蝉(*Empoasca fabae*),Empoasca solana;绵蚜属(*Eriosoma* spp.),斑叶蝉属(*Erythroneura* spp.),扁盾蝽属(*Eurygaster* spp.)比如麦扁盾蝽(*Eurygaster integriceps*);Euschelis bilobatus,美洲蝽属(*Euschistus* spp.)比如Euschistus heros,褐美洲蝽(*Euschistus impictiventris*),褐美洲蝽(*Euschistus servus*);咖啡地粉蚧(*Geococcus coffeae*),茶翅蝽属(*Halyomorpha* spp.)比如茶翅蝽

(*Halyomorpha halys*); *Heliopeltis* spp., 假桃病毒叶蝉(*Homalodisca coagulata*), *Horcias nobilellus*, 梅大尾蚜(*Hyalopterus pruni*), 茶蔗苦菜超瘤蚜(*Hyperomyzus lactucae*), 吹绵蚧属(*Icerya* spp.), 片角叶蝉属(*Idiocerus* spp.), 扁喙叶蝉属(*Idioscopus* spp.), 灰飞虱(*Laodelphax striatellus*), 球蚧属(*Lecanium* spp.), 蛎盾蚧属(*Lepidosaphes* spp.), 稻缘蝽属(*Leptocorisa* spp.), 棉铃喙缘蝽(*Leptoglossus phyllopus*), 萝卜蚜(*Lipaphis erysimi*), 草盲蝽属(*Lygus* spp.) 比如豆荚盲蝽(*Lygus hesperus*), 美国牧草盲蝽(*Lygus lineolaris*), 牧草盲蝽(*Lygus pratensis*); *Macropes excavatus*, 长管蚜属(*Macrosiphum* spp.) 比如 *Macrosiphum rosae*, 麦长管蚜(*Macrosiphum avenae*), 马铃薯长管蚜(*Macrosiphum euphorbiae*); *Mahanarva fimbriolata*, 筛豆龟蝽(*Megacopta cribraria*), 巢菜修尾蚜(*Megoura viciae*), *Melanaphis pyraeius*, 高粱蚜森林型(*Melanaphis sacchari*), *Metcafiella* spp., 麦无网蚜(*Metopolophium dirhodum*), 盲蝽科(*Miridae* spp.), 黑缘平翅斑蚜(*Monellia costalis*), *Monelliopsis pecanis*, 瘤蚜属(*Myzus* spp.) 比如冬葱瘤蚜(*Myzus ascalonicus*), 樱桃瘤蚜(*Myzus cerasi*), 桃蚜(*Myzus persicae*), 黄药子瘤蚜(*Myzus varians*); 莴苣衲长管蚜(*Nasonovia ribis-nigri*), 黑尾叶蝉属(*Nephotettix* spp.) 比如马来亚黑尾叶蝉(*Nephotettix malayanus*), 二条黑尾叶蝉(*Nephotettix nigropictus*), 细小黑尾叶蝉(*Nephotettix parvus*), 二点黑尾叶蝉(*Nephotettix virescens*); 绿蝽属(*Nezara* spp.) 比如稻绿蝽(*Nezara viridula*); 褐飞虱(*Nilaparvata lugens*), *Oebalus* spp., *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, 杨梅缘粉虱(*Parabemisia myricae*), 薯个木虱属(*Paratrioza* spp.), 片盾蚧属(*Parlatoria* spp.), 瘿绵蚜属(*Pemphigus* spp.) 比如柄瘿绵蚜(*Pemphigus bursarius*); *Pentomidae*, 玉米花翅飞虱(*Peregrinus maidis*), 甘蔗扁角飞虱(*Perkinsiella saccharicida*), 绵粉蚧属(*Phenacoccus* spp.), 杨平翅绵蚜(*Phloeomyzus passerinii*), 忽布疣蚜(*Phorodon humuli*), 倭蚜属(*Phylloxera* spp.), 方背皮蝽(*Piesma quadrata*), 壁蝽属(*Piezodorus* spp.) 比如 *Piezodorus guildinii*, 百合并盾蚧(*Pinnaspis aspidistrae*), 臀纹粉蚧属(*Planococcus* spp.), 梨形原绵蚧(*Protopulvinaria pyriformis*), 棉跳盲蝽(*Psallus seriatus*), *Pseudacysta perseae*, 桑白盾蚧(*Pseudaulacaspis pentagona*), 粉蚧属(*Pseudococcus* spp.) 比如康氏粉蚧(*Pseudococcus comstocki*); 木虱属(*Psylla* spp.) 比如苹木虱(*Psylla mali*), *Psylla piri*; 金小蜂属(*Pteromalus* spp.), *Pyrilla* spp., 笠圆盾蚧属(*Quadraspidiotus* spp.), *Quesada gigas*, 平刺粉蚧属(*Rastrococcus* spp.), *Reduvius senilis*, 红猎蝽属(*Rhodnius* spp.), 冬葱缢瘤蚜(*Rhopalomyzus ascalonicus*), 缢管蚜属(*Rhopalosiphum* spp.) 比如伪甘蓝缢管蚜(*Rhopalosiphum pseudobrassicae*), 苹果缢管蚜(*Rhopalosiphum insertum*), 玉米缢管蚜(*Rhopalosiphum maidis*), 禾谷缢管蚜(*Rhopalosiphum padi*); *Sagatodes* spp., 可可褐盲蝽(*Sahlbergella singularis*), 黑盔蚧属(*Saissetia* spp.), *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Scaphoides titanus*, 麦二叉蚜(*Schizaphis graminum*), 榆梨绵蚜(*Schizoneura lanuginosa*), 黑蝽属(*Scotinophora* spp.), 苏铁刺圆盾蚧(*Selenaspidus articulatus*), 麦长管蚜(*Sitobion avenae*), 长唇基飞虱属(*Sogatella* spp.), 白背飞虱(*Sogatella furcifera*), *Solubea insularis*, 梨冠网蝽(*Stephanitis nashi*), 三角蝉(*Stictocephala festina*), *Tenalaphara malayensis*, *Thyanta* spp. 比如

Thyanta perditor; *Tibraca* spp., 美国核桃黑蚜(*Tinocallis caryaefoliae*), 广胸沫蝉属(*Tomaspis* spp.), 声蚜属(*Toxoptera* spp.) 比如橘声蚜(*Toxoptera aurantii*); 粉虱属(*Trialeurodes* spp.) 比如温室粉虱(*Trialeurodes vaporariorum*); 椎猎蝽属(*Triatoma* spp.), 个木虱属(*Trioza* spp.), 小叶蝉属(*Typhlocyba* spp.), 尖盾蚧属(*Unaspis* spp.) 比如矢尖蚧(*Unaspis yanonensis*); 和葡萄根瘤蚜(*Viteus vitifolii*),

[0998] 蚂蚁, 蜜蜂, 胡蜂, 叶蜂(膜翅目(*Hymenoptera*)), 例如菜叶蜂(*Athalia rosae*), *Atta capiguara*, *Atta cephalotes*, *Atta cephalotes*, *Atta laevigata*, *Atta robusta*, 切叶蚁(*Atta sexdens*), 德州切叶蚁(*Atta texana*), 熊蜂属(*Bombus* spp.), *Camponotus floridanus*, 举腹蚊属(*Crematogaster* spp.), *Dasymutilla occidentalis*, 松叶蜂属(*Diprion* spp.), *Dolichovespula maculata*, 实叶蜂属(*Hoplocampa* spp.) 比如李实叶蜂(*Hoplocampa minuta*), 苹实叶蜂(*Hoplocampa testudinea*); 毛蚁属(*Lasius* spp.) 比如黑毛蚁(*Lasius niger*), *Linepithema humile*, 小家蚁(*Monomorium pharaonis*), *Paravespula germanica*, *Paravespula pennsylvanica*, *Paravespula vulgaris*, 褐大头蚁(*Pheidole megacephala*), *Pogonomyrmex barbatus*, *Pogonomyrmex californicus*, *Polistes rubiginosa*, 火蚁(*Solenopsis geminata*), 阿根廷火蚁(*Solenopsis invicta*), *Solenopsis richteri*, *Solenopsis xyloni*, 胡蜂属(*Vespa* spp.) 比如黄边胡蜂(*Vespa crabro*), 和 *Vespa squamosa*,

[0999] 蟋蟀, 蚱蜢, 蝗虫(直翅目(*Orthoptera*)), 例如家蟋(*Acheta domestica*), 意大利蝗(*Calliptamus italicus*), 澳洲草栖蝗(*Chortoicetes terminifera*), 摩洛哥戟纹蝗(*Dociostaurus maroccanus*), 非洲蝼蛄(*Gryllotalpa africana*), 欧洲蝼蛄(*Gryllotalpa gryllotalpa*), 非洲蔗蝗(*Hieroglyphus daganensis*), 印度黄檀蝗(*Kraussaria angulifera*), 亚洲飞蝗(*Locusta migratoria*), 褐飞拟飞蝗(*Locustana pardalina*), 双带黑蝗(*Melanoplus bivittatus*), 赤胫黑蝗(*Melanoplus femurrubrum*), 墨西哥黑蝗(*Melanoplus mexicanus*), 血黑蝗(*Melanoplus sanguinipes*), 石枯黑蝗(*Melanoplus spretus*), 红蝗(*Nomadacris septemfasciata*), 塞纳加尔小车蝗(*Oedaleus senegalensis*), 美洲沙漠蝗(*Schistocerca americana*), 沙漠蝗(*Schistocerca gregaria*), 温室沙螽(*Tachycines asynamorus*), 和 *Zonozerus variegatus*,

[1000] 蛛形动物(蛛形纲(*Arachnida*)), 比如蜱螨亚纲(*Acar*i), 例如软蜱科(*Argasidae*), 硬蜱科(*Ixodidae*) 和疥螨科(*Sarcoptidae*), 比如花蜱属(*Amblyomma* spp.) (例如美洲花蜱(*Amblyomma americanum*), 彩饰花蜱(*Amblyomma variegatum*), 花蜱属叶芹(*Amblyomma maculatum*)), 锐缘蜱属(*Argas* spp.) (例如波斯锐缘蜱(*Argas persicus*)), 牛蜱属(*Boophilus* spp.) (例如具环牛蜱(*Boophilus annulatus*), 消色牛蜱(*Boophilus decoloratus*), 微小牛蜱(*Boophilus microplus*)), 森林革蜱(*Dermacentor silvarum*), 安氏革蜱(*Dermacentor andersoni*), 变异革蜱(*Dermacentor variabilis*), 璃眼蜱属(*Hyalomma* spp.) (例如 *Hyalomma truncatum*), 硬蜱属(*Ixodes* spp.) (例如蓖子硬蜱(*Ixodes ricinus*), *Ixodes rubicundus*, *Ixodes scapularis*, 全环硬蜱(*Ixodes holocyclus*), *Ixodes pacificus*), 钝缘蜱属(*Ornithodoros* spp.) (例如 *Ornithodoros moubata*), *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata*), 柏氏禽刺螨(*Ornithonyssus bacoti*), *Otobius megnini*, 鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*), 瘙螨属(*Psoroptes* spp.)

(例如绵羊痒螨(*Psoroptes ovis*),扇头蜱属(*Rhipicephalus* spp.)(例如血红扇头蜱(*Rhipicephalus sanguineus*),非洲扇头蜱(*Rhipicephalus appendiculatus*),*Rhipicephalus evertsi*),根嗜螨属(*Rhizoglyphus* spp.),疥螨属(*Sarcoptes* spp.)(例如人疥螨(*Sarcoptes scabiei*)),和瘿螨科(*Eriophyidae* spp.)比如*Acaria sheldoni*,刺皮瘿螨属(*Aculops* spp.)(例如桔刺皮瘿螨(*Aculops pelekassi*))针刺瘿螨属(*Aculus* spp.)(例如斯氏针刺瘿螨(*Aculus schlechtendali*)),梨上瘿螨(*Epitrimerus pyri*),柑橘皱叶刺瘿螨(*Phyllocoptruta oleivora*)和瘿螨属(*Eriophyes* spp.)(例如*Eriophyes sheldoni*);跗线螨科(*Tarsonemidae* spp.)比如半跗线螨属(*Hemitarsonemus* spp.),樱草植食螨(*Phytonemus pallidus*)和侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonemus latus*),*Stenotarsonemus* spp.;细须螨科(*Tenuipalpidae* spp.)比如短须螨属(*Brevipalpus* spp.)(例如紫红短须螨(*Brevipalpus phoenicis*));叶螨科(*Tetranychidae* spp.)比如始叶螨属(*Eotetranychus* spp.),真叶螨属(*Eutetranychus* spp.),小爪螨属(*Oligonychus* spp.),朱砂叶螨(*Tetranychus cinnabarinus*),神泽氏叶螨(*Tetranychus kanzawai*),太平洋叶螨(*Tetranychus pacificus*),椴两点叶螨(*Tetranychus telarius*)和二斑叶螨(*Tetranychus urticae*);苜蓿苔螨(*Bryobia praetiosa*),全爪螨属(*Panonychus* spp.)(例如苹果全爪螨(*Panonychus ulmi*),柑橘全爪螨(*Panonychus citri*)),*Metatetranychus* spp.和小爪螨属(*Oligonychus* spp.)(例如草地小爪螨(*Oligonychus pratensis*)),番茄斜背瘤瘿螨(*Vasates lycopersici*);蛛形目(*Araneida*),例如红斑蛛(*Latrodectus mactans*),和褐平甲蛛(*Loxosceles reclusa*)。和粗脚粉螨(*Acarus siro*),痒螨属(*Chorioptes* spp.),中东金蝎(*Scorpio maurus*)

[1001] 蚤(蚤目(*Siphonaptera*)),例如角叶蚤属(*Ceratophyllus* spp.),猫栉首蚤(*Ctenocephalides felis*),犬栉首蚤(*Ctenocephalides canis*),印鼠客蚤(*Xenopsylla cheopis*),人蚤(*Pulex irritans*),穿皮潜蚤(*Tunga penetrans*),和具带病蚤(*Nosopsyllus fasciatus*),

[1002] 衣鱼,家衣鱼(缨尾目(*Thysanura*)),例如西洋衣鱼(*Lepisma saccharina*)和家衣鱼(*Thermobia domestica*),

[1003] 蜈蚣(唇足纲(*Chilopoda*)),例如地蜈蚣属(*Geophilus* spp.),蚰蜒属(*Scutigera* spp.)比如*Scutigera coleoptrata*;

[1004] 千足虫(倍足纲(*Diplopoda*)),例如*Blaniulus guttulatus*,*Narceus* spp.,

[1005] 蠼螋(革翅目(*Dermaptera*)),例如*Forficula auricularia*,

[1006] 虱(虱目(*Phthiraptera*)),例如畜虱属(*Damalinia* spp.),人虱属(*Pediculus* spp.)比如头虱(*Pediculus humanus capitis*),*Pediculus humanus corporis*; *Pthirus pubis*,血虱属(*Haematopinus* spp.)比如牛血虱(*Haematopinus eurysternus*),猪血虱(*Haematopinus suis*);长颚虱属(*Linognathus* spp.)比如牛颚虱(*Linognathus vituli*);*Bovicola bovis*,*Menopon gallinae*,雏鸡羽虱(*Menacanthus stramineus*)和牛管虱(*Solenopotes capillatus*),嚼虱属(*Trichodectes* spp.),

[1007] 跳虫(弹尾目(*Collembola*)),例如棘跳虫属(*Onychiurus* spp.)比如武装棘跳虫(*Onychiurus armatus*),

[1008] 它们也适于防治线虫:植物寄生线虫比如根结线虫,北方根结线虫(*Meloidogyne*

hapla), 南方根结线虫(*Meloidogyne incognita*), 爪哇根结线虫(*Meloidogyne javanica*), 和其它根结线虫属(*Meloidogyne*) 种类; 成囊线虫, 马铃薯金线虫(*Globodera rostochiensis*) 和其它球异皮线虫属(*Globodera*) 种类; 燕麦胞囊线虫(*Heterodera avenae*), *Heterodera glycines*, 甜菜异皮线虫(*Heterodera schachtii*), 三叶草异皮线虫(*Heterodera trifolii*), 和其它异皮线虫属(*Heterodera*) 种类; 种瘿线虫, 瘿线虫属(*Anguina*) 种类; 茎干和叶面线虫, 滑刃线虫属(*Aphelenchoides*) 种类比如水稻干尖线虫(*Aphelenchoides besseyi*); 刺线虫, 长尾刺线虫(*Belonolaimus longicaudatus*) 和其它刺线虫属(*Belonolaimus*) 种类; 松线虫, 日本黑松干线虫(*Bursaphelenchus lignicolus* Mamiya et Kiyohara), 松材线虫(*Bursaphelenchus xylophilus*) 和其它伞滑刃线虫属(*Bursaphelenchus*) 种类; 环线虫, 环线虫属(*Criconema*) 种类, 小环线虫属(*Criconemella*) 种类, 轮线虫属(*Criconemoides*) 种类, 间环线虫属(*Mesocriconema*) 种类; 茎干和鳞茎线虫, 马铃薯茎线虫(*Ditylenchus destructor*), 起绒草茎线虫(*Ditylenchus dipsaci*) 和其它茎线虫属(*Ditylenchus*) 种类; 锥线虫, 锥线虫属(*Dolichodorus*) 种类; 螺旋线虫, *Helicotylenchus multicinctus* 和其它螺旋线虫属(*Helicotylenchus*) 种类; 鞘线虫和拟鞘线虫, 鞘线虫属(*Hemicycliophora*) 种类和半轮线虫属(*Hemicriconemoides*) 种类; *Hirshmanniella* 种类; 喷枪线虫, 纽带线虫属(*Hoploaimus*) 种类; 伪根结线虫, 真珠线虫属(*Nacobbus*) 种类; 长针线虫, 逸去长针线虫(*Longidorus elongatus*) 和其它长针线虫属(*Longidorus*) 种类; 根斑线虫, 短尾短体线虫(*Pratylenchus brachyurus*), 落选短体线虫(*Pratylenchus neglectus*), 穿刺短体线虫(*Pratylenchus penetrans*), *Pratylenchus curvatus*, 古氏短体线虫(*Pratylenchus goodeyi*) 和其它短体线虫属(*Pratylenchus*) 种类; 潜伏线虫, 相似穿孔线虫(*Radopholus similis*) 和其它穿孔线虫属(*Radopholus*) 种类; 肾形线虫, 强壮盘旋线虫(*Rotylenchus robustus*), 肾形线虫(*Rotylenchus reniformis*) 和其它盘旋线虫属(*Rotylenchus*) 种类; 盾状线虫属(*Scutellonema*) 种类; 粗短根线虫, 原始毛刺线虫(*Trichodorus primitivus*) 和其它毛刺线虫属(*Trichodorus*) 种类, 类毛刺线虫属(*Paratrachodorus*) 种类; 矮化线虫, 克莱顿矮化线虫(*Tylenchorhynchus claytoni*), 不定矮化线虫(*Tylenchorhynchus dubius*) 和其它矮化线虫属(*Tylenchorhynchus*) 种类; 柑桔线虫, 小垫刃线虫属(*Tylenchulus*) 种类比如半穿刺线虫(*Tylenchulus semipenetrans*); 剑线虫, 剑线虫属(*Xiphinema*) 种类; 和其它植物寄生线虫种类。

[1009] 可以用式(I)化合物防治的其它病虫害种类的实例包括: Bivalva 纲, 例如饰贝属(*Dreissena* spp.); 腹足纲(*Gastropoda*), 例如阿勇蛞蝓属(*Arion* spp.), 双脐螺属(*Biomphalaria* spp.), 泡螺属(*Bulinus* spp.), 灰蛞蝓属(*Deroceras* spp.), 土蜗属(*Galba* spp.), 椎实螺属(*Lymnaea* spp.), 钉螺属(*Oncomelania* spp.), 琥珀螺属(*Succinea* spp.); 蠕虫纲, 例如十二指肠钩虫(*Ancylostoma duodenale*), *Ancylostoma ceylanicum*, *Ancylostoma braziliensis*, 钩口线虫属(*Ancylostoma* spp.), 人蛔虫(*Ascaris lumbricoides*), 蛔虫属(*Ascaris* spp.), 马来布鲁线虫(*Brugia malayi*), *Brugia timori*, 仰口线虫属(*Bunostomum* spp.), 夏伯特线虫属(*Chabertia* spp.), 支睾吸虫属(*Clonorchis* spp.), 古柏线虫属(*Cooperia* spp.), 双腔吸虫属(*Dicrocoelium* spp.), 丝状网尾线虫(*Dictyocaulus filaria*), 心形裂头绦虫(*Diphyllobothrium latum*), *Dracunculus medinensis*, 细粒棘球绦虫(*Echinococcus granulosus*), *Echinococcus*

multilocularis, 蛲虫(*Enterobius vermicularis*), *Faciola* spp., 血矛线虫(*Haemonchus* spp.) 比如捻转血矛线虫(*Haemonchus contortus*); 异刺属(*Heterakis* spp.), 微小膜壳绦虫(*Hymenolepis nana*), *Hyostrogylus* spp., 罗阿丝虫属(*Loa*) 罗阿丝虫属(*Loa*), 细颈线虫属(*Nematodirus* spp.), 结节线虫属(*Oesophagostomum* spp.), 后睾吸虫属(*Opisthorchis* spp.), 盘尾丝虫(*Onchocerca volvulus*), 奥斯特线虫属(*Ostertagia* spp.), 并殖吸虫属(*Paragonimus* spp.), *Schistosomen* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., 牛带绦虫(*Taenia saginata*), 猪带绦虫(*Taenia solium*), 旋毛形线虫(*Trichinella spiralis*), *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*, 毛圆线虫属(*Trichostrongylus* spp.), *Trichuris trichuria*, 班氏吴策线虫(*Wuchereria bancrofti*); 等足目(*Isopoda*), 例如 *Armadillidium vulgare*, 潮虫(*Oniscus asellus*), 鼠妇(*Porcellio scaber*); 综合纲(*Symphyla*), 例如白松虫(*Scutigerella immaculata*);

[1010] 可以用式(I)化合物防治的病虫害种类的其它实例包括: 奥国金龟甲(*Anisoplia austriaca*), 秀夜蛾属(*Apamea* spp.), *Austroasca viridigrisea*, 稻蓟马(*Baliothrips biformis*), 秀丽隐杆线虫(*Caenorhabditis elegans*), 茎蜂属(*Cephus* spp.), *Ceutorhynchus napi*, 麦跳甲(*Chaetocnema aridula*), 台湾稻螟(*Chilo auricilius*), 蔗条螟(*Chilo indicus*), 稻多丽螟(*Chilo polychrysus*), 澳洲草栖蝗(*Chortiocetes terminifera*), 稻纵卷叶螟(*Cnaphalocroci medinalis*), 纵卷叶野螟属(*Cnaphalocrosis* spp.), 苜蓿粉蝶(*Colias eurytheme*), *Collops* spp., *Cornitermes cumulans*, 秀盲蝽属(*Creontiades* spp.), 圆头金龟属(*Cyclocephala* spp.), *Dalbulus maidis*, *Deraceras reticulatum*, 小蔗秆草螟(*Diatrea saccharalis*), *Dichelops furcatus*, 稻铁甲虫(*Dicladispa armigera*), *Diloboderus* spp. 比如 *Diloboderus abderus*; *Edessa* spp., 叶小卷蛾属(*Epinotia* spp.), 蚁科(*Formicidae*), 大眼长蝽(*Geocoris* spp.), 黄球白蚁(*Globitermes sulfureus*), 蝼蛄科(*Gryllotalpidae*), 红足海镰螯螨(*Halotydeus destructor*), *Hipnodes bicolor*, 菲律宾稻水蝇(*Hydrellia philippina*), 马陆属(*Julus* spp.), 灰飞虱属(*Laodelphax* spp.), 大稻缘蝽(*Leptocorsia acuta*), 大稻缘蝽(*Leptocorsia oratorius*), *Liogenys fuscus*, 绿蝇属(*Lucillia* spp.), *Lyogenys fuscus*, *Mahanarva* spp., *Maladera matrida*, 刷须野螟属(*Marasmia* spp.), 澳白蚁属(*Mastotermes* spp.), 粉蚧, 美洲叶甲属(*Megascelis* spp.), 西印度蔗象甲(*Metamasius hemipterus*), *Microtheca* spp., *Mocis latipes*, *Murgantia* spp., 粘虫(*Mythemina separata*), *Neocapritermes opacus*, *Neocapritermes parvus*, *Neomegalotomus* spp., 新白蚁属(*Neotermes* spp.), 稻三点水螟(*Nymphula depunctalis*), *Oebalus pugnax*, 瘿蚊属(*Orseolia* spp.) 比如 *Orseolia oryzae*; 棉籽尖长蝽(*Oxycaraenus hyalinipennis*), 金斑蛾属(*Plusia* spp.), 小管福寿螺(*Pomacea canaliculata*), *Procornitermes* spp., *Procornitermes triacifer*, 蚤跳甲属(*Psylloides* spp.), *Rachiplusia* spp., 钻孔线虫属(*Rhodopholus* spp.), *Scaptocoris castanea*, *Scaptocoris* spp., 白禾螟属(*Scirpophaga* spp.) 比如三化螟(*Scirpophaga incertulas*), 稻白禾螟(*Scirpophaga innotata*); 黑蝽属(*Scotinophara* spp.) 比如马来亚稻黑蝽(*Scotinophara coarctata*);

蛀茎夜蛾属(*Sesamia* spp.)比如稻蛀茎夜蛾(*Sesamia inferens*),白背飞虱(*Sogatella frucifera*),火蚁(*Solenopsis geminata*),膜翅角蝉属(*Spissistilus* spp.),茎螟(*Stalk borer*),稻蓟马(*Stenchaetothrips biformis*),斯氏狭附线螨(*Steneotarsonemus pinki*),棉卷叶野螟(*Sylepta derogata*),*Telehin licus*,毛圆线虫属(*Trichostrongylus* spp.)。

[1011] 本发明化合物,包括其盐、立体异构体和互变异构体,特别有用地防治昆虫,优选吸血或穿孔和咀嚼和叮咬昆虫比如鳞翅目(Lepidoptera),鞘翅目(Coleoptera)和半翅目(Hemiptera),尤其是鳞翅目(Lepidoptera),鞘翅目(Coleoptera)和半翅昆虫(true bugs)的昆虫。

[1012] 本发明化合物,包括其盐、立体异构体和互变异构体,另外有用地防治缨翅目(Thysanoptera),双翅目(Diptera)(特别是蝇、蚊),膜翅目(Hymenoptera)(特别是蚂蚁)和等翅目(Isoptera)(特别是白蚁)的昆虫。

[1013] 本发明化合物,包括其盐、立体异构体和互变异构体,特别有用地防治鳞翅目(Lepidoptera)和鞘翅目(Coleoptera)的昆虫。

[1014] 本发明也涉及农业化学组合物,其包含辅剂和至少一种根据本发明的化合物I。

[1015] 农业化学组合物包含农药有效量的化合物I。术语“有效量”表示一定量的组合物或化合物I,其足以防治栽培植物上或在保护材料中的有害真菌并且其不引起对所处理的植物的实质损害。所述量能够在宽范围变化并且取决于各种因素,比如待防治的种类,处理的栽培植物或材料,气候条件和所用的特定化合物I。

[1016] 化合物I、其N-氧化物和盐能够转化为常规类型的农业化学组合物,例如溶液,乳液,悬浮液,粉剂,粉末,糊剂,颗粒剂,压制物,胶囊及其混合物。组合物类型的实例是悬浮液(例如SC,OD,FS),乳油(例如EC),乳液(例如EW,E0,ES,ME),胶囊(例如CS,ZC),糊剂,软锭,可湿性粉剂或粉剂(例如WP,SP,WS,DP,DS),压制物(例如BR,TB,DT),颗粒剂(例如WG,SG,GR,FG,GG,MG),杀虫制品(例如LN),以及处理植物繁殖材料比如种子的胶状物配制剂(例如GF)。这些和其它组合物类型定义在“Catalogue of pesticide formulation types and international coding system”,Technical Monograph No.2,6th Ed.May 2008,CropLife International当中。

[1017] 组合物以已知方式制备,比如Mollet and Grubemann,Formulation technology,Wiley VCH,Weinheim,2001;或Knowles,New developments in crop protection product formulation,Agrow Reports DS243,T&F Informa,London,2005的描述。

[1018] 适宜的辅剂是溶剂,液体载体,固体载体或填料,表面活性剂,分散剂,乳化剂,湿润剂,助剂,增溶剂,穿透增强剂,保护性胶体,粘着剂,增稠剂,保湿剂,驱避剂,吸引剂,摄食刺激剂,增容剂,杀菌剂,防冻剂,消泡剂,着色剂,增粘剂和粘合剂。

[1019] 适宜的溶剂和液体载体是水和有机溶剂,比如中等至高沸点的矿物油级分,例如煤油、柴油;植物或动物来源的油;脂族,环状和芳烃,例如甲苯、石蜡、四氢萘、烷基化的萘;醇,例如乙醇、丙醇、丁醇、苄基醇、环己醇;二醇;DMSO;酮、例如环己酮;酯,例如乳酸酯、碳酸酯、脂肪酸酯、 γ -丁内酯;脂肪酸;磷酸酯;胺;酰胺,例如N-甲基吡咯烷酮、脂肪酸二甲基酰胺;及其混合物。

[1020] 适宜的固体载体或填料是矿物土,例如硅酸盐,硅胶,滑石,高岭土,石灰石,石灰,

白垩,粘土,白云石,硅藻土,斑脱土,硫酸钙,硫酸镁,氧化镁;多糖,例如纤维素,淀粉;肥料,例如硫酸铵,磷酸铵,硝酸铵,脲;植物来源的产品,例如谷屑,树皮屑,木屑,果壳屑及其混合物。

[1021] 适宜的表面活性剂是表面活性的化合物,比如阴离子,阳离子,非离子和两性表面活性剂,嵌段聚合物,聚电解质及其混合物。所述表面活性剂能够用作乳化剂,分散剂,增溶剂,湿润剂,穿透增强剂,保护性胶体或助剂。表面活性剂的实例列于McCutcheon's, Vol.1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008 (International Ed. or North American Ed.)。

[1022] 适宜的阴离子表面活性剂是磺酸酯、硫酸酯、磷酸酯、羧酸酯的碱金属、碱土金属或铵盐,及其混合物。磺酸酯的实例是烷基芳基磺酸酯,二苯基磺酸酯, α -烯烴磺酸酯,木质素磺酸酯,脂肪酸和油的磺酸酯,乙氧基化烷基酚类的磺酸酯,烷氧基化芳基酚的磺酸酯,稠合萘的磺酸酯,十二烷基苯和十三烷基苯的磺酸酯,萘和烷基萘的磺酸酯,磺基琥珀酸酯或磺基琥珀酰胺磺酸酯。硫酸酯的实例是脂肪酸和油,乙氧基化烷基酚类,醇,乙氧基化醇,或脂肪酸酯的硫酸酯。各种磷酸酯的实例是磷酸酯。羧酸酯的实例是烷基羧酸酯,和羧基化醇或烷基酚乙氧基化物。

[1023] 适宜的非离子表面活性剂是烷氧基化物,N-取代的脂肪酸酰胺,胺氧化物,酯,糖基表面活性剂,聚合物表面活性剂及其混合物。烷氧基化物的实例是化合物比如醇,烷基酚类,胺,酰胺,芳基酚,脂肪酸或脂肪酸酯,其已用1至50当量烷氧基化。环氧乙烷和/或环氧丙烷可以用于烷氧基化,优选环氧乙烷。N-取代的脂肪酸酰胺的实例是脂肪酸葡糖酰胺(glucamides)或脂肪酸烷醇酰胺。酯的实例是脂肪酸酯,甘油酯或甘油单酯。糖基表面活性剂的实例是脱水山梨糖醇,乙氧基化的脱水山梨糖醇,蔗糖和葡萄糖酯或烷基聚糖苷。聚合物表面活性剂的实例是乙烯基吡咯烷酮,乙烯基醇或乙酸乙烯酯的均聚物或共聚物。

[1024] 适宜的阳离子表面活性剂是季铵表面活性剂,例如具有一个或两个疏水基团的季铵化合物,或长链伯胺的盐。适宜的两性表面活性剂是烷基内铵盐和咪唑啉。适宜的嵌段聚合物是A-B或A-B-A类型的嵌段聚合物,包含聚环氧乙烷和聚丙烯氧化物的嵌段;或者A-B-C类型的嵌段聚合物,包含烷醇,聚环氧乙烷和聚丙烯氧化物。适宜的聚电解质是多元酸或多元碱。多元酸的实例是聚丙烯酸或多元酸梳形聚合物的碱盐。多元碱的实例是聚乙烯胺或聚乙烯胺。

[1025] 适宜的助剂是化合物,其本身具有可忽略的农药活性或甚至不具有农药活性,并且其改善化合物I对靶标的生物学效力。实例是表面活性剂,矿物油或植物油和其它辅剂。其它实例列于Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, 第5章。

[1026] 适宜的增稠剂是多糖(例如黄原胶,羧甲基纤维素),无机粘土(有机地修饰的或未修饰的),聚羧酸酯和硅酸盐。

[1027] 适宜的杀菌剂是溴硝醇和异噻唑啉酮衍生物比如烷基异噻唑啉酮和苯并异噻唑啉酮。

[1028] 适宜的防冻剂是乙二醇,丙二醇,尿素和甘油。

[1029] 适宜的消泡剂是有机硅,长链醇和脂肪酸的盐。

[1030] 适宜的着色剂(例如红色、蓝色或绿色)是低水溶解度的色素和水可溶的染料。实

例是无机着色剂(例如铁氧化物,钛氧化物,六氰基高铁酸铁)和有机着色剂(例如茜素着色剂,偶氮着色剂和酞菁着色剂)。

[1031] 适宜的增粘剂或粘合剂是聚乙烯吡咯烷酮,聚乙酸乙烯酯,聚乙烯醇,聚丙烯酸类,生物蜡或合成蜡,和纤维素醚。

[1032] 组合物类型及其制备的实例如下:

[1033] i)水溶性浓缩物(SL,LS)

[1034] 将10-60wt%的本发明化合物I和5-15重量%润湿剂(例如醇烷氧基化物)溶于水 and/或水可溶的溶剂(例如醇),总计100重量%。活性物质在用水稀释时溶解。

[1035] ii)可分散液剂(DC)

[1036] 将5-25wt%的本发明化合物I和1-10重量%分散剂(例如聚乙烯基吡咯烷酮)溶于有机溶剂(例如环己酮),总计100重量%。用水稀释,提供分散液。

[1037] iii)乳油(EC)

[1038] 将15-70wt%的本发明化合物I和5-10重量%乳化剂(例如十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物)溶于水不溶的有机溶剂(例如芳烃),总计100重量%。用水稀释,提供乳液。

[1039] iv)乳液(EW,EO,ES)

[1040] 将5-40wt%的本发明化合物I和1-10重量%乳化剂(例如十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物)溶于20-40重量%水不溶的有机溶剂(例如芳烃)。通过乳化装置将该混合物引入水中,总计100重量%,并且制成均质乳液。用水稀释,提供乳液。

[1041] v)悬浮液(SC,OD,FS)

[1042] 在搅动的球磨机中,粉碎20-60wt%的本发明化合物I并加入2-10重量%分散剂和润湿剂(例如木质素磺酸钠和醇乙氧基化物)、0.1-2重量%增稠剂(例如黄原胶)和水,总计100重量%,提供细分的活性物质悬浮液。用水稀释,提供活性物质的稳定悬浮液。对于FS类型组合物,加入多至40重量%粘合剂(例如聚乙烯醇)。

[1043] vi)水可分散性粒剂和水可溶性颗粒剂(WG,SG)

[1044] 仔细研磨50-80wt%的本发明化合物I并加入分散剂和润湿剂(例如木质素磺酸钠和醇乙氧基化物),总计100重量%,并通过技术设备(例如挤出,喷雾塔,流化床)制备为水可分散的或水可溶的颗粒剂。用水稀释,提供活性物质的稳定分散液或溶液。

[1045] vii)水可分散性粉剂和水可溶性粉剂(WP,SP,WS)

[1046] 在转子-定子研磨机中研磨50-80wt%的本发明化合物I并加入1-5重量%分散剂(例如木质素磺酸钠)、1-3重量%润湿剂(例如醇乙氧基化物)和固体载体(例如硅胶),总计100重量%。用水稀释,提供活性物质的稳定分散液或溶液。

[1047] viii)凝胶(GW,GF)

[1048] 在搅动的球磨机中,研磨5-25wt%的本发明化合物I并加入3-10重量%分散剂(例如木质素磺酸钠)、1-5重量%增稠剂(例如羧甲纤维素)和水,总计100重量%,提供活性物质的细分悬浮液。用水稀释,提供活性物质的稳定悬浮液。

[1049] iv)微乳剂(ME)

[1050] 将5-20wt%的本发明化合物I加至5-30重量%有机溶剂共混物(例如脂肪酸二甲基酰胺和环己酮)、10-25重量%表面活性剂共混物(例如醇乙氧基化物和芳基酚乙氧基化

物)和水,总计100%。搅拌该混合物1小时,以自发产生热力学稳定的微乳剂。

[1051] iv)微胶囊(CS)

[1052] 将包含5-50wt%的本发明化合物I、0-40重量%水不溶的有机溶剂(例如芳烃),2-15重量%丙烯酸单体(例如甲基丙烯酸甲酯,甲基丙烯酸和二-或三丙烯酸酯)的油相分散入保护性胶体(例如聚乙烯醇)的水溶液。通过自由基引发剂引发自由基聚合,引起聚(甲基)丙烯酸酯微胶囊的形成。另选地,将包含5-50wt%的本发明化合物I、0-40重量%水不溶的有机溶剂(例如芳烃)和异氰酸酯单体(例如二苯基甲烷-4,4'-二异氰酸酯)的油相分散入保护性胶体(例如聚乙烯醇)的水溶液。加入多元胺(例如己二胺),引起聚脲微胶囊的形成。单体的量为1-10重量%。重量%是相对总的CS组合物。

[1053] ix)粉剂(DP,DS)

[1054] 仔细磨碎1-10wt%的本发明化合物I并与固体载体(例如细分高岭土)密切混合,总计100重量%。

[1055] x)颗粒剂(GR,FG)

[1056] 仔细磨碎0.5-30wt%的本发明化合物I并与固体载体(例如硅酸盐)结合,总计100重量%。通过挤出、喷雾干燥或流化床实现造粒。

[1057] xi)超低容量液剂(UL)

[1058] 将1-50wt%的本发明化合物I溶于有机溶剂(例如芳烃),总计100重量%。

[1059] 组合物类型i)至xi)可以任选包含其它辅剂,比如0.1-1重量%杀菌剂,5-15重量%防冻剂,0.1-1重量%消泡剂,和0.1-1重量%着色剂。

[1060] 农业化学组合物一般包含0.01至95%,优选0.1至90%,和尤其是0.5至75%重量的活性物质。活性物质以90%至100%,优选95%至100%(根据NMR谱)的纯度使用。

[1061] 用于种子处理剂的溶液(LS),悬乳剂(Suspensions)(SE),悬浮种衣剂(FS),干燥处理粉末(DS),用于浆料处理的水可分散粉剂(WS),水可溶性粉剂(SS),乳液(ES),乳油(EC)和凝胶(GF)通常用于处理植物繁殖材料、特别是种子的目的。有关的组合物在2至10倍稀释之后在即用制剂中提供的活性物质浓度是0.01至60%重量,优选0.1至40%重量。施用能够在播种之前或在播种期间进行。分别施用化合物I及其组合物至植物繁殖材料、特别是种子上的方法包括繁殖材料的敷料,包衣,制粒,喷粉,浸泡和沟内施用方法。优选,通过不诱导发芽的方法例如种衣剂、制粒、包衣和喷粉将化合物I或其组合物分别施用至植物繁殖材料上。

[1062] 在用于植物保护当中时,取决于希望的效果类型,所施用的活性物质质量是0.001至2kg/ha,优选0.005至2kg/ha,更优选0.05至0.9kg/ha,和尤其是0.1至0.75kg/ha。

[1063] 在例如通过喷粉、包衣或浇灌种子来处理植物繁殖材料比如种子时,一般需要的活性物质质量是0.1至1000g,优选1至1000g,更优选1至100g和最优选5至100g,每100千克植物繁殖材料(优选种子)。

[1064] 在用于保护材料或储存产品时,所施用的活性物质质量取决于施用区域和希望效果的类型。在保护材料中常规施用的量是0.001g至2kg,优选0.005g至1kg活性物质/立方米处理物质。

[1065] 各种类型的油,湿润剂,助剂,肥料或微量营养素,和其它农药(例如除草剂,杀虫剂,杀真菌剂,生长调节剂,安全剂)可以添加至活性物质或包含它们的组合物以充当预混

物,或如果适当则临使用前才添加(桶混)。这些试剂能够与本发明组合物以1:100至100:1、优选1:10至10:1的重量比混合。

[1066] 使用者通常从预剂量装置,背负式喷雾器,喷雾槽,喷雾飞行器或灌溉系统施用本发明组合物。通常,用水、缓冲剂和/或其它辅剂使农业化学组合物构成希望施用浓度,如此获得根据本发明的即用喷雾液或农业化学组合物。通常,每公顷农业有用面积施用20至2000升、优选50至400升的即用喷雾液。

[1067] 根据一种实施方式,本发明组合物的单独组分比如试剂盒部分或二元或三元混合物部分可以由使用者本身在喷雾槽中混合,并且如果适当可以加入其它辅剂。

[1068] 在其它实施方式中,本发明组合物的单独组分或部分预混的组分例如包含化合物I和/或类别M)或F)的活性物质(参见下文)的组分,可以由使用者在喷雾槽中混合,和如果适当可以加入其它辅剂和添加剂。

[1069] 在其它实施方式中,本发明组合物的单独组分或部分预混组分例如包含化合物I和/或类别M.1至M.UN.X或F.I至F.XII活性物质的组分,能够共同地施用(例如在桶混之后)或连续地施用。

[1070] 本发明化合物能够与之一一起使用的并且可能与之产生潜在增效效果的下述农药列表M(按Insecticide Resistance Action Committee(IRAC)的作用模式分级分类)期望说明可能的组合,但并不强加任何限制:

[1071] M.1乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂,来自下述类别:

[1072] M.1A氨基甲酸酯类,例如涕灭威,棉铃威,噁虫威,丙硫克百威,丁酮威,丁酮砒威,甲萘威,克百威,丁硫克百威,乙硫苯威,仲丁威,伐虫脒,呋线威,异丙威,甲硫威,灭多威,速灭威,杀线威,抗蚜威,残杀威,硫双威,久效威,混杀威,灭除威,灭杀威和唑蚜威;或来自下述类别:

[1073] M.1B有机磷酸酯类,例如乙酰甲胺磷,甲基吡啶磷,益棉磷,保棉磷,硫线磷,氯氧磷,毒虫畏,氯甲硫磷,毒死蜱,甲基毒死蜱,蝇毒磷,杀螟腈,甲基内吸磷-S,二嗪磷,敌敌畏/DDVP,百治磷,乐果,甲基毒虫畏,乙拌磷,苯硫磷,乙硫磷,灭线磷,伐灭磷,苯线磷,杀螟硫磷,倍硫磷,噻唑磷,庚烯磷,imicyafos,异柳磷,0-(甲氧基氨基硫基-磷酰基)水杨酸异丙酯,噁唑磷,马拉硫磷,灭蚜磷,甲胺磷,杀扑磷,速灭磷,久效磷,二溴磷,氧乐果,亚砒磷,对硫磷,甲基对硫磷,稻丰散,甲拌磷,伏杀硫磷,亚胺硫磷,磷胺,辛硫磷,嘧啶磷酸(pirimiphos)-甲酯,丙溴磷,胺丙畏,丙硫磷,吡啶硫磷,哒嗪硫磷,啉硫磷,治螟磷,tebupirimfos,双硫磷,特丁硫磷,杀虫畏,甲基乙拌磷,三唑磷,敌百虫和蚜灭磷;

[1074] M.2.GABA-门控氯阴离子通道拮抗剂比如:

[1075] M.2A环二烯有机氯化物,例如硫丹或氯丹;或

[1076] M.2B苯基吡啶类(fiproles)(苯基吡啶),例如乙虫腈,氟虫腈,丁烯氟虫腈(flufiprole),pyrafluprole和pyriprole;

[1077] M.3钠通道调节剂,来自下述类别:

[1078] M.3A拟除虫菊酯,例如氟丙菊酯,烯丙菊酯,d-顺式-反式烯丙菊酯,d-反式烯丙菊酯,联苯菊酯,生物烯丙菊酯,生物烯丙菊酯S-环戊烯基,生物苄呋菊酯,乙氰菊酯,氟氯氰菊酯,高效氟氯氰菊酯,氯氟氰菊酯,高效氯氟氰菊酯,精高效氯氟氰菊酯,氯氰菊酯, α -氯氰菊酯,高效氯氰菊酯,高效反式氯氰菊酯,zeta-氯氰菊酯,苯醚氰菊酯,溴氰菊酯,右旋烯

炔菊酯, S-氰戊菊酯, 醚菊酯, 甲氰菊酯, 氰戊菊酯, 氟氰戊菊酯, 氟氯苯菊酯, 氟胺氰菊酯, 苄螨醚, 炔咪菊酯, 氯氟醚菊酯, 甲氧苄氟菊酯, momfluorothrin, 氯菊酯, 苯醚菊酯, 炔丙菊酯, profluthrin, 除虫菊素(除虫菊), 苄呋菊酯, 氟硅菊酯, 七氟菊酯, 四氟醚菊酯, 胺菊酯, 四溴菊酯和四氟苯菊酯;或

[1079] M.3B钠通道调节剂比如滴滴涕或甲氧滴滴涕;

[1080] M.4烟酸乙酰胆碱受体激动剂(nAChR), 来自下述类别:

[1081] M.4A新烟碱类, 例如啉虫脒, 噻虫胺, 呋虫胺, 吡虫啉, 烯啶虫胺, 噻虫啉和噻虫嗪;或下述化合物

[1082] M.4A.1:1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2,3,5,6,7,8-六氢-9-硝基-(5S,8R)-5,8-桥氧基-1H-咪唑并[1,2-a]氮杂**草**;或

[1083] M.4A.2:1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-硝基-1-[(E)-亚戊基氨基]胍;或

[1084] M4.A.3:1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-7-甲基-8-硝基-5-丙氧基-3,5,6,7-四氢-2H-咪唑并[1,2-a]吡啶;

[1085] 或M.4B烟碱。

[1086] M.5烟酸乙酰胆碱受体变构活化剂, 来自下述类别:多杀霉素类(spinosyns),

[1087] 例如多杀霉素或乙基多杀菌素;

[1088] M.6氯阴离子通道活化剂, 来自下述类别:阿维菌素类(ivermectins)和密比霉素类(milbemycins), 例如阿维菌素, 甲氨基阿维菌素苯甲酸盐, 依维菌素, lepipimectin或弥拜菌素(milbemectin);

[1089] M.7保幼激素模拟物, 比如

[1090] M.7A保幼激素类似物例如烯虫乙酯, 烯虫炔酯和烯虫酯;或其它例如M.7B苯氧威或M.7C吡丙醚;

[1091] M.8各种非特异性(多位点)抑制剂, 例如

[1092] M.8A烷基卤例如溴甲烷和其它烷基卤, 或

[1093] M.8B氯化苦, 或M.8C硫酰氟, 或M.8D硼砂, 或M.8E酒石催吐药;

[1094] M.9选择性的同翅昆虫摄食阻断剂, 例如

[1095] M.9B吡蚜酮, 或M.9C氟啶虫酰胺;

[1096] M.10螨生长抑制剂, 例如

[1097] M.10A四螨嗪, 噻螨酮和氟螨嗪, 或M.10B乙螨唑;

[1098] M.11昆虫中肠膜的微生物破坏剂, 例如苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*)或球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus*)和杀虫蛋白, 它们产生比如苏云金芽孢杆菌israelensis亚种, 球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus*), 苏云金芽孢杆菌aizawai亚种, 苏云金芽孢杆菌kurstaki亚种和苏云金芽孢杆菌tenebrionis亚种, 或Bt作物蛋白:Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb和Cry34/35Ab1;

[1099] M.12线粒体ATP合成酶的抑制剂, 例如

[1100] M.12A丁醚脲, 或

[1101] M.12B有机锡杀螨剂比如三唑锡, 三环锡或苯丁锡, 或M.12C炔螨特, 或M.12D三氯杀螨砒;

[1102] M.13经由扰乱质子梯度的氧化磷酸化解偶联剂, 例如虫螨脒, 二硝酚或氟虫胺;

- [1103] M.14烟酸乙酰胆碱受体(nAChR)通道阻断剂,例如沙蚕毒素类似物比如杀虫磺,杀螟丹盐酸盐,杀虫环或杀虫酸(thiosultap)钠;
- [1104] M.15壳多糖生物合成类型0的抑制剂,比如苯甲酰脲例如双三氟虫脲,氟啶脲,除虫脲,氟环脲,氟虫脲,氟铃脲,虱螨脲,氟酰脲,多氟脲,氟苯脲或杀铃脲;
- [1105] M.16壳多糖生物合成类型1的抑制剂,例如噻嗪酮;
- [1106] M.17蜕皮破坏剂,双翅目(Dipteran),例如灭蝇胺;
- [1107] M.18蜕皮素受体激动剂比如二酰基肼类,例如甲氧虫酰肼,虫酰肼,氯虫酰肼,呋喃虫酰肼(fufenozide)或环虫酰肼;
- [1108] M.19章鱼胺受体激动剂,例如双甲脒;
- [1109] M.20线粒体复合物III电子运输抑制剂,例如
- [1110] M.20A氟蚁腓,或M.20B灭螨醌,或M.20C噻螨酯;
- [1111] M.21线粒体复合物I电子运输抑制剂,例如
- [1112] M.21A METI杀螨剂和杀昆虫剂比如喹螨醚,唑螨酯,噻螨醚,哒螨灵,吡螨胺或唑虫酰胺,或M.21B鱼藤酮;
- [1113] M.22电压依赖性钠通道阻断剂,例如
- [1114] M.22A茚虫威,或M.22B氰氟虫腓,或M.22C 1-[(E)-[2-(4-氰基苯基)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]氨基]-3-[4-(二氟甲氧基)苯基]尿素;
- [1115] M.23乙酰基CoA羧化酶的抑制剂,比如特窗酸和吡咯酮酸(tetramic acid)衍生物,例如螺螨酯,螺特杀(spiromesifen)或螺虫乙酯;
- [1116] M.24线粒体复合物IV电子运输抑制剂,例如
- [1117] M.24A膦比如磷化铝,磷化钙,膦或
- [1118] 磷化锌,或M.24B氰化物。
- [1119] M.25线粒体复合物II电子运输抑制剂,比如beta-酮腈衍生物,例如苯腈吡螨酯(cyenopyrafen)或丁氟螨酯;
- [1120] M.28鱼尼汀(ryanodine)受体-调节剂,来自下述类别:二酰胺类,例如氟苯虫酰胺,氯虫苯甲酰胺(**rynaxypyr®**),氰虫苯甲酰胺(cyantraniliprole)(**cyazypyr®**),或邻苯二甲酰胺化合物
- [1121] M.28.1:(R)-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-甲磺酰基乙基)邻苯二甲酰胺和
- [1122] M.28.2:(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-甲磺酰基乙基)邻苯二甲酰胺,或化合物
- [1123] M.28.3:3-溴-N-{2-溴-4-氯-6-[(1-环丙基乙基)氨基甲酰基]苯基}-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-甲酰胺(建议ISO名:cyclaniliprole),或化合物
- [1124] M.28.4:甲基-2-[3,5-二溴-2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基}氨基)苯甲酰基]-1,2-二甲基肼羧酸酯;或选自M.28.5a)至M.28.51)的化合物:
- [1125] M.28.5a)N-[4,6-二氯-2-[(二乙基-λ-4-硫烷基亚基)氨基甲酰基]-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(三氟甲基)吡唑-3-甲酰胺;
- [1126] M.28.5b)N-[4-氯-2-[(二乙基-λ-4-硫烷基亚基)氨基甲酰基]-6-甲基-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(三氟甲基)吡唑-3-甲酰胺;

- [1127] M.28.5c)N-[4-氯-2-[(二-2-丙基-λ-4-硫烷基亚基)氨基甲酰基]-6-甲基-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(三氟甲基)吡啶-3-甲酰胺;
- [1128] M.28.5d)N-[4,6-二氯-2-[(二-2-丙基-λ-4-硫烷基亚基)氨基甲酰基]-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(三氟甲基)吡啶-3-甲酰胺;
- [1129] M.28.5e)N-[4,6-二氯-2-[(二乙基-λ-4-硫烷基亚基)氨基甲酰基]-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(二氟甲基)吡啶-3-甲酰胺;
- [1130] M.28.5f)N-[4,6-二溴-2-[(二-2-丙基-λ-4-硫烷基亚基)氨基甲酰基]-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(三氟甲基)吡啶-3-甲酰胺;
- [1131] M.28.5g)N-[4-氯-2-[(二-2-丙基-λ-4-硫烷基亚基)氨基甲酰基]-6-氰基-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(三氟甲基)吡啶-3-甲酰胺;
- [1132] M.28.5h)N-[4,6-二溴-2-[(二乙基-λ-4-硫烷基亚基)氨基甲酰基]-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(三氟甲基)吡啶-3-甲酰胺;
- [1133] M.28.5i)N-[2-(5-氨基-1,3,4-噁二唑-2-基)-4-氯-6-甲基-苯基]-5-溴-2-(3-氯-2-吡啶基)吡啶-3-甲酰胺;
- [1134] M.28.5j)5-氯-2-(3-氯-2-吡啶基)-N-[2,4-二氯-6-[(1-氰基-1-甲基-乙基)氨基甲酰基]苯基]吡啶-3-甲酰胺;
- [1135] M.28.5k)5-溴-N-[2,4-二氯-6-(甲基氨基甲酰基)苯基]-2-(3,5-二氯-2-吡啶基)吡啶-3-甲酰胺;
- [1136] M.28.5l)N-[2-(叔丁基氨基甲酰基)-4-氯-6-甲基-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(氟甲氧基)吡啶-3-甲酰胺;或化合物选自
- [1137] M.28.6N2-(1-氰基-1-甲基-乙基)-N1-(2,4-二甲基苯基)-3-碘-邻苯二甲酰胺;或
- [1138] M.28.73-氯-N2-(1-氰基-1-甲基-乙基)-N1-(2,4-二甲基苯基)邻苯二甲酰胺;
- [1139] M.UN.X未知或不确定作用模式的杀虫活性化合物,例如印楝素,amidoflumet,苯螨特,联苯腈酯,溴螨酯,灭螨猛,冰晶石,三氯杀螨醇,flufenerim,flometoquin,fluensulfone,flupyradifurone,增效醚,三氟甲吡醚,七氟虫酰胺(pyrifluquinazon),氟啉虫胺腈(sulfoxaflor),pyflubumide或化合物
- [1140] M.UN.X.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-乙基氨基甲酰基)-甲基]-苯甲酰胺,或化合物
- [1141] M.UN.X.2: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,或化合物
- [1142] M.UN.X.3:11-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-12-羟基-1,4-二氧杂-9-氮杂二螺[4.2.4.2]-十四碳-11-烯-10-酮,或化合物
- [1143] M.UN.X.4:3-(4'-氟-2,4-二甲基联苯-3-基)-4-羟基-8-氧杂-1-氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮,或化合物
- [1144] M.UN.X.5:1-[2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亚磺酰基]苯基]-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺,或基于坚强芽孢杆菌(*Bacillus firmus*)的活性物(Votivo,I-

1582);或

[1145] M.UN.X.6;选自下述的化合物

[1146] M.UN.X.6a)(E/Z)-N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-亚吡啶基]-2,2,2-三氟-乙酰胺;

[1147] M.UN.X.6b)(E/Z)-N-[1-[(6-氯-5-氟-3-吡啶基)甲基]-2-亚吡啶基]-2,2,2-三氟-乙酰胺;

[1148] M.UN.X.6c)(E/Z)-2,2,2-三氟-N-[1-[(6-氟-3-吡啶基)甲基]-2-亚吡啶基]乙酰胺;

[1149] M.UN.X.6d)(E/Z)-N-[1-[(6-溴-3-吡啶基)甲基]-2-亚吡啶基]-2,2,2-三氟-乙酰胺;

[1150] M.UN.X.6e)(E/Z)-N-[1-[1-(6-氯-3-吡啶基)乙基]-2-亚吡啶基]-2,2,2-三氟-乙酰胺;

[1151] M.UN.X.6f)(E/Z)-N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-亚吡啶基]-2,2-二氟-乙酰胺;

[1152] M.UN.X.6g)(E/Z)-2-氯-N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-亚吡啶基]-2,2-二氟-乙酰胺;

[1153] M.UN.X.6h)(E/Z)-N-[1-[(2-氯嘧啶-5-基)甲基]-2-亚吡啶基]-2,2,2-三氟-乙酰胺和

[1154] M.UN.X.6i)(E/Z)-N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-亚吡啶基]-2,2,3,3,3-五氟-丙酰胺);或化合物

[1155] M.UN.X.7:3-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-4-氧代-1-(嘧啶-5-基甲基)吡啶并[1,2-a]嘧啶-1-鎓-2-醇盐;或

[1156] M.UN.X.8:8-氯-N-[2-氯-5-甲氧基苯基]磺酰基]-6-三氟甲基)-咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;或

[1157] M.UN.X.9:4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(1-氧代硫杂环丁烷-3-基)苯甲酰胺;或

[1158] M.UN.X.10:5-[3-[2,6-二氯-4-(3,3-二氯烯丙基氧基)苯氧基]丙氧基]-1H-吡唑;或

[1159] M.UN.X.11:4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-[2-氧代-2-(2,2,2-三氟乙基氨基)乙基]苯甲酰胺;或

[1160] M.UN.X.12:4-[5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[2-氧代-2-(2,2,2-三氟乙基氨基)乙基]萘-1-甲酰胺。

[1161] 上文所列类型M的可商购化合物可以参见The Pesticide Manual,15th Edition, C.D.S.Tomlin,British Crop Protection Council(2011)以及其它出版物。

[1162] 喹啉衍生物flometoquin示于W02006/013896。氨基呋喃酮化合物flupyradifurone已知自W02007/115644。磺基脲化合物氟啉虫胺腈(sulfoxaflor)已知自W02007/149134。杀螨剂pyflubumide已知自W02007/020986。异噁唑啉化合物已有描述:M.UN.X.1在W02005/085216中,M.UN.X.9在W02013/050317中,M.UN.X.11在W02005/085216中而M.UN.X.在W02009/002809和W02011/149749中。pyripyropene衍生物M.UN.X.2已描述

于WO 2006/129714。螺缩酮-取代的环状酮烯醇衍生物M.UN.X.3已知自WO2006/089633和联苯-取代的螺环酮烯醇衍生物M.UN.X.4已知自WO2008/067911。最终,三唑基苯基硫化物如M.UN.X.5已描述于WO2006/043635和基于坚强芽孢杆菌(*Bacillus firmus*)的生物学控制剂描述于WO2009/124707。新烟碱类4A.1已知自WO20120/069266和WO2011/06946,M.4.A.2已知自WO2013/003977,M4.A.3.已知自WO2010/069266。

[1163] 氰氟虫腈类似物M.22C描述于CN 10171577。邻苯二甲酰胺M.28.1和M.28.2都已知自WO 2007/101540。邻氨基苯甲酰胺M.28.3已描述于WO2005/077934。酰肼化合物M.28.4已描述于WO2007/043677。邻氨基苯甲酰胺M.28.5a)至M.28.5h)能够按WO2007/006670,WO2013/024009和WO2013/024010中的描述制备,邻氨基苯甲酰胺M.28.5i)描述于WO2011/085575,M.28.5j)描述于WO2008/134969,M.28.5k)描述于US2011/046186和M.28.5l)描述于WO2012/034403。二酰胺化合物M.28.6和M.28.7能够参见CN102613183。

[1164] 列于M.UN.X.6的化合物M.UN.X.6a)至M.UN.X.6i)已描述于WO2012/029672。介离子拮抗剂化合物M.UN.X.7描述于WO2012/092115,杀线虫剂M.UN.X.8描述于WO2013/055584和三氟甲吡醚-类型类似物M.UN.X.10描述于WO2010/060379。

[1165] 优选的额外农药活性成分是那些,其选自IRAC第1组,乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂,选自本文1A组,(氨基甲酸酯)硫双威,灭多威和甲萘威,和1B组(有机磷酸酯类),特别是乙酰甲胺磷,毒死蜱和乐果,选自2B组,苯基吡唑类(fiproles),本文特别是乙虫腈和氟虫腈,选自3组,拟除虫菊酯,本文特别是高效氯氟氰菊酯, α -氯氰菊酯或溴氰菊酯,和选自4A组,新烟碱类,本文特别是啉虫脒,噻虫胺,呋虫胺,吡虫啉,烯啶虫胺,噻虫啉或噻虫嗪。

[1166] 特别是,本发明化合物与苯基吡唑类(fiproles)、新烟碱类或拟除虫菊酯的组合可能展示对蝽、尤其是美洲蝽属(*Euschistus*)例如*Euschistus heros*的增效防治(根据Colby公式)。

[1167] 本发明化合物能够与之结合使用的活性物质的下述列表F期望说明可能的组合而非限制它们:

[1168] F.I)呼吸抑制剂

[1169] F.I-1)Qo位点的复合物III抑制剂:

[1170] 嗜球果伞素类:啞菌酯,甲香菌酯(coumethoxystrobin),丁香菌酯,二甲苯氧菌胺,烯肟菌酯,氟啞菌酯,醚菌酯,苯氧菌胺,肟醚菌胺,啞氧菌酯,吡唑醚菌酯,唑胺菌酯,唑菌酯,吡菌苯威(pyribencarb),氯啞菌酯(triclopyricarb)/氯啞菌酯(chlorodincarb),肟菌酯,2-[2-(2,5-二甲基-苯氧基甲基)-苯基]-3-甲氧基-丙烯酸甲酯和2(2-(3-(2,6-二氯苯基)-1-甲基-亚烷基氨基氧基甲基)-苯基)-2-甲氧基亚氨基-N甲基-乙酰胺;

[1171] 噁唑烷二酮和咪唑啉酮:噁唑菌酮,咪唑菌酮;

[1172] F.I-2)复合物II抑制剂(例如甲酰胺):

[1173] 羧酰苯胺类:麦锈灵,苯并烯氟菌唑(benzovindiflupyr),联苯唑酰胺(bixafen),啞酰菌胺,萎锈灵,甲呋酰胺,环酰菌胺,氟吡菌酰胺,氟酰胺,呋吡菌胺,吡酰菌胺(isopyrazam),异噁菌胺(isotianil),灭锈胺,氧化萎锈灵,己唑菌胺(penflufen),吡噁菌胺(penthioopyrad),环丙唑菌胺(sedaxane),叶枯酞,噁氟菌胺,噁唑菌酰胺,2-氨基-4-甲基-噁唑-5-羧酰基苯胺,N-(3',4',5'三氟联苯-2-基)-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺(fluxapyroxad),N-(4'-三氟甲硫基联苯-2-基)-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰

胺,N-(2-(1,3,3-三甲基-丁基)-苯基)-1,3-二甲基-5-氟-1H-吡唑-4-甲酰胺,3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基茚满-4-基)吡唑-4-甲酰胺,3-(三氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基茚满-4-基)吡唑-4-甲酰胺,1,3-二甲基-N-(1,1,3-三甲基茚满-4-基)吡唑-4-甲酰胺,3-(二氟甲基)-1,5-二甲基-N-(1,1,3-三甲基茚满-4-基)吡唑-4-甲酰胺,3-(二氟甲基)-1,5-二甲基-N-(1,1,3-三甲基茚满-4-基)吡唑-4-甲酰胺,1,3,5-三甲基-N-(1,1,3-三甲基茚满-4-基)吡唑-4-甲酰胺,3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基茚满-4-基)吡唑-4-甲酰胺,3-(三氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基茚满-4-基)吡唑-4-甲酰胺,1,3-二甲基-N-(1,1,3-三甲基茚满-4-基)吡唑-4-甲酰胺,3-(三氟甲基)-1,5-二甲基-N-(1,1,3-三甲基茚满-4-基)吡唑-4-甲酰胺,3-(二氟甲基)-1,5-二甲基-N-(1,1,3-三甲基茚满-4-基)吡唑-4-甲酰胺,1,3,5-三甲基-N-(1,1,3-三甲基茚满-4-基)吡唑-4-甲酰胺;

[1174] F.I-3)Qi位点的复合物III抑制剂:氟霜唑,吡唑磺菌胺(amisulbrom),[(3S,6S,7R,8R)-8-苄基-3-[(3-乙酰氧基-4-甲氧基-吡啶-2-羰基)氨基]-6-甲基-4,9-二氧代-1,5-二氧杂环戊烷-7-基]2-甲基丙酸酯,[(3S,6S,7R,8R)-8-苄基-3-[[3-(乙酰氧基甲氧基)-4-甲氧基-吡啶-2-羰基]氨基]-6-甲基-4,9-二氧代-1,5-二氧杂环戊烷-7-基]2-甲基丙酸酯,[(3S,6S,7R,8R)-8-苄基-3-[(3-异丁氧基羰氧基-4-甲氧基-吡啶-2-羰基)氨基]-6-甲基-4,9-二氧代-1,5-二氧杂环戊烷-7-基]2-甲基丙酸酯,[(3S,6S,7R,8R)-8-苄基-3-[[3-(1,3-苯并二氧杂环戊二烯-5-基甲氧基)-4-甲氧基-吡啶-2-羰基]氨基]-6-甲基-4,9-二氧代-1,5-二氧杂环戊烷-7-基]2-甲基丙酸酯,3S,6S,7R,8R)-3-[[3-(3-羟基-4-甲氧基-2-吡啶基)羰基]氨基]-6-甲基-4,9-二氧代-8-(苯基甲基)-1,5-二氧杂环戊烷-7-基2-甲基丙酸酯;

[1175] F.I-4)其它呼吸抑制剂(复合物I,解偶联剂)氟啉菌胺;(5,8-二氟喹唑啉-4-基)-{2-[2-氟-4-(4-三氟甲基吡啶-2-基氧基)-苯基]-乙基}-胺;四氯硝基苯;ametoctradin;硅噻菌胺;硝基苯基衍生物:乐杀螨,消螨通,二硝基巴豆酸酯,氟啉胺,啉菌胺,酞菌酯,

[1176] 和包括有机金属化合物:三苯锡盐,比如三苯锡-乙酸盐,三苯基氯化锡或三苯基氢氧化锡;

[1177] F.II)固醇生物合成抑制剂(SBI杀真菌剂)

[1178] F.II-1)C14脱甲基酶抑制剂(DMI杀真菌剂,例如三唑类,咪唑)

[1179] 三唑:氧环唑,联苯三唑醇,糠菌唑,环丙唑醇,苯醚甲环唑,烯唑醇,R-烯唑醇,氟环唑,腈苯唑,氟唑唑,氟硅唑,粉唑醇,己唑醇,亚胺唑,种菌唑,叶菌唑,腈菌唑,多效唑,戊菌唑,丙环唑,丙硫菌唑,硅氟唑,戊唑醇,四氟醚唑,三唑酮,三唑醇,灭菌唑,烯效唑,1-[rel-(2S;3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)-环氧乙烷基甲基]-5-氰硫基-1H-[1,2,4]三唑,2-[rel-(2S;3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)-环氧乙烷基甲基]-2H-[1,2,4]三唑-3-硫醇;

[1180] 咪唑:抑霉唑,稻瘟酯,噁咪唑(oxpoconazole),咪鲜胺,氟菌唑;

[1181] 嘧啶、吡啶和哌嗪:氯苯嘧啶醇,氟苯嘧啶醇,啉斑肟,噻氨灵,1-[rel-(2S;3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)-环氧乙烷基甲基]-5-氰硫基-1H-[1,2,4]三唑,2-[rel-(2S;3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)-环氧乙烷基甲基]-2H-[1,2,4]三唑-3-硫醇;

[1182] F.II-2)Delta14-还原酶抑制剂(胺,例如吗啉,哌啶)

[1183] 吗啉:aldimorph,十二环吗啉,十二环吗啉-乙酸盐,丁苯吗啉,十三吗啉;

- [1184] 哌啶:苯锈啶,哌丙灵;螺缩酮胺:螺环菌胺;
- [1185] F.II-3)3-酮还原酶抑制剂:羟基酰基苯胺:环酰菌胺;
- [1186] F.III)核酸合成抑制剂
- [1187] F.III-1)RNA,DNA合成
- [1188] 苯基酰胺或酰基氨基酸杀真菌剂:苯霜灵,精苯霜灵,精甲霜灵(kiralaxyl),甲霜灵,精甲霜灵(精甲霜灵),呋酰胺,噁霜灵;
- [1189] 异噁唑和异噻唑酮:噁霉灵(hymexazole),辛噻酮;
- [1190] F.III-2)DNA拓扑异构酶抑制剂:喹菌酮;
- [1191] F.III-3)核苷酸代谢(例如腺苷-脱氨基酶),羟基(2-氨基)-嘧啶:乙嘧酚磺酸酯;
- [1192] F.IV)细胞分裂和/或细胞骨架抑制剂
- [1193] F.IV-1)微管蛋白抑制剂:苯并咪唑和硫菌灵类:苯菌灵,多菌灵,麦穗宁,噻菌灵,甲基硫菌灵;
- [1194] 三唑并嘧啶:5-氯-7(4-甲基哌啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)-[1,2,4]三唑并[1,5a]嘧啶;
- [1195] F.IV-2)其它细胞分裂抑制剂
- [1196] 苯甲酰胺和苯基乙酰胺:乙霉威,噻唑菌胺,戊菌隆,氟吡菌胺,苯酰菌胺;
- [1197] F.IV-3)肌动蛋白抑制剂:二苯甲酮:苯菌酮(metrafenone),pyriofenone;
- [1198] F.V)氨基酸和蛋白质合成抑制剂
- [1199] F.V-1)甲硫氨酸合成抑制剂(苯胺基-嘧啶类)
- [1200] 苯胺基-嘧啶类:嘧菌环胺,嘧菌胺,三氯甲基吡啶,嘧霉胺;
- [1201] F.V-2)蛋白质合成抑制剂(苯胺基-嘧啶类)
- [1202] 抗生素:灭瘟素,春雷霉素,春雷霉素盐酸盐-水合物,灭粉霉素,链霉素,土霉素,多氧菌素,有效霉素A;
- [1203] F.VI)信号转导抑制剂
- [1204] F.VI-1)MAP/组氨酸激酶抑制剂(例如苯胺基-嘧啶类)
- [1205] 二甲酰亚胺:氟氯菌核利,异菌脲,腐霉利,乙烯菌核利;
- [1206] 苯基吡咯:拌种咯,咯菌腈;
- [1207] F.VI-2)G蛋白质抑制剂:喹啉:苯氧喹啉(quinoxifen);
- [1208] F.VII)脂质和膜合成抑制剂
- [1209] F.VII-1)磷脂生物合成抑制剂
- [1210] 有机磷化合物:敌瘟磷,异稻瘟净,吡菌磷;
- [1211] 二硫杂环戊烷:稻瘟灵;
- [1212] F.VII-2)脂质过氧化:芳炔:氯硝胺,五氯硝基苯,四氯硝基苯,甲基立枯磷,联苯,氯苯甲醚,土菌灵;
- [1213] F.VII-3)羧酸酰胺(CAA杀真菌剂)
- [1214] 肉桂酸或扁桃酸酰胺:烯酰吗啉,氟吗啉,双炔酰菌胺,丁吡吗啉(pyrimorph);
- [1215] 缬氨酰胺(valinamide)氨基甲酸酯类:苯噻菌胺(benthiavalicarb),缬霉威,吡菌苯威(pyribencarb),缬氨菌酯(valifenalate)和N-(1-(1-(4-氟基-苯基)乙烷磺酰基)-丁-2-基)氨基甲酸-(4-氟苯基)酯;

- [1216] F.VII-4)影响细胞膜渗透性的化合物和脂肪酸:
- [1217] 1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-3-异噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮,氨基甲酸酯类:霜霉威,霜霉威-盐酸盐,
- [1218] F.VII-5)脂肪酸酰胺水解酶抑制剂:1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-3-异噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮;
- [1219] F.VIII)多位点作用的抑制剂
- [1220] F.VIII-1)无机活性物质:波尔多液,乙酸铜,氢氧化铜,王铜,碱式硫酸铜,硫磺;
- [1221] F.VIII-2)硫代-和二硫代氨基甲酸酯:福美铁,代森锰锌,代森锰,百亩酸(metam),磺菌威,代森联,丙森锌,福美双,代森锌,福美锌;
- [1222] F.VIII-3)有机氯化物(例如邻苯二甲酰亚胺,磺酰胺,氯腈):
- [1223] 敌菌灵,百菌清,敌菌丹,克菌丹,灭菌丹,苯氟磺胺,双氯酚,磺菌胺,六氯苯,五氯酚及其盐,四氯苯酞,甲苯氟磺胺,N-(4-氯-2-硝基-苯基)-N-乙基-4-甲基-苯磺酰胺;
- [1224] F.VIII-4)胍和其它:胍,多果定,多果定游离碱,双胍辛,双胍辛-乙酸盐,双胍辛胺,双胍辛胺-三乙酸盐,双胍辛胺-三(烷苯磺酸盐),2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二硫杂环己二烯并[2,3-c:5,6-c']二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮;
- [1225] F.VIII-5)蒽醌:二氰蒽醌;
- [1226] F.IX)细胞壁合成抑制剂
- [1227] F.IX-1)葡聚糖合成抑制剂:有效霉素,多抗霉素B;
- [1228] F.IX-2)黑色素合成抑制剂:咯嗪酮,三环唑,环丙酰菌胺,dicyclomet,稻瘟酰胺;
- [1229] F.X)植物防御诱导剂
- [1230] F.X-1)水杨酸途径:活化酯;
- [1231] F.X-2)其它:烯丙苯噻唑,异噻菌胺(isotianil),噻唑菌酰胺,调环酸钙;
- [1232] 膦酸盐:乙膦酸,三乙膦酸铝,亚磷酸及其盐;
- [1233] F.XI)未知作用模式:溴硝醇,灭螨猛,环氟苄酰胺,霜脍氰,棉隆,咪菌威,哒菌酮,野燕枯,野燕枯-甲基硫酸盐,二苯基胺,胺苯吡菌酮(fenpyrazamine),氟酰菌胺,磺菌胺,氟噻菌灵(flutianil),磺菌威,三氯甲基吡啶,酞菌酯,oxathiapiprolin,啉啉铜,丙氧啉,tebufloquin,叶枯酞,咪唑啉,2-丁氧基-6-碘-3-丙基色烯-4-酮,N-(环丙基甲氧基亚氨基)-(6-二氟-甲氧基-2,3-二氟-苯基)-甲基)-2-苯基乙酰胺,N'-(4-(4-氯-3-三氟甲基-苯氧基)-2,5-二甲基-苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒,N'-(4-(4-氟-3-三氟甲基-苯氧基)-2,5-二甲基-苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒,N'-(2-甲基-5-三氟甲基-4-(3-三甲基甲硅烷基-丙氧基)-苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒,N'-(5-二氟甲基-2-甲基-4-(3-三甲基甲硅烷基-丙氧基)-苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒,2-{1-[2-(5-甲基-3-三氟甲基-吡唑-1-基)-乙酰基]-哌啶-4-基}-噻唑-4-羧酸甲基-(1,2,3,4-四氢-萘-1-基)-酰胺,2-{1-[2-(5-甲基-3-三氟甲基-吡唑-1-基)-乙酰基]-哌啶-4-基}-噻唑-4-羧酸甲基-(R)-1,2,3,4-四氢-萘-1-基-酰胺,甲氧基-乙酸6-叔丁基-8-氟-2,3-二甲基-啉啉-4-基酯和N-甲基-2-{1-[(5-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-1-基)-乙酰基]-哌啶-4-基}-N-[(1R)-1,2,3,4-四氢萘-1-基]-4-噻唑甲酰胺,3-[5-(4-氯-苯基)-2,3-二甲基-异噁唑烷-3-基]-吡啶,啉啉啉唑(pyrisoxazole),5-氨基-2-异丙基-3-氧代-4-邻-甲苯基-2,3-二氢-吡唑-1-硫代羧酸S-烯丙基酯,N-(6-甲氧基-吡啶-3-基)环丙烷羧酸酰胺,5-氯-1(4,6-二甲氧基-噻啶-2-基)-2-甲基-1H-苯并咪

唑,2-(4-氯-苯基)-N-[4-(3,4-二甲氧基-苯基)-异噁唑-5-基]-2-丙-2-炔基氧基-乙酰胺,。

[1234] F.XII)生长调节剂:S-诱抗素,先甲草胺(amidochlor),环丙嘧啶醇,6-苄氨基嘌呤,芸苔素内酯,仲丁灵,矮壮素(矮壮素),氯化胆碱,环丙酰胺酸,丁酰肼,调呋酸,噻节因,2,6-二甲基吡啶,乙烯利,氟节胺,呋嘧醇,噻草酸,氯吡脞,赤霉酸,抗倒胺,吡啶-3-乙酸,抑芽丹,氟磺酰草胺,mepiquat(甲哌鎗),萘乙酸,N 6-苄基腺嘌呤,多效唑,调环酸(调环酸钙),prohydrojasmon,噻苯隆,抑芽唑,三硫代磷酸三丁基酯,2,3,5三碘苯甲酸,抗倒酯和烯效唑;

[1235] F.XIII)生物学防治剂

[1236] *Ampelomyces quisqualis*(例如**AQ 10**[®],来自Intrachem Bio GmbH & Co.KG,德国),黄曲霉(*Aspergillus flavus*)(例如**AFLAGUARD**[®],来自Syngenta,CH),出芽短梗霉(*Aureobasidium pullulans*)(例如**BOTECTOR**[®],来自bio-ferm GmbH,德国),短小芽孢杆菌(*Bacillus pumilus*)(例如NRRL Accession No.B-30087,**SONATA**[®]和**BALLAD**[®]Plus,来自AgraQuest Inc.,USA),枯草芽孢杆菌(*Bacillus subtilis*)(例如分离株NRRL-Nr.B-21661,**RHAPSODY**[®],**SERENADE**[®]MAX和**SERENADE**[®]AS0,来自AgraQuest Inc.,USA),枯草芽孢杆菌*amyloliquefaciens*变种FZB24(例如**TAEGRO**[®],来自Novozyme Biologicals,Inc.,USA),嗜油念珠菌(*Candida oleophila*)I-82(例如**ASPIRE**[®],来自Ecogen Inc.,USA),*Candida saitoana*(例如**BIOCURE**[®](与溶菌酶的混合物)和**BIOCOAT**[®],来自Micro Flo Company,USA(BASF SE)和Arysta),几丁聚糖(例如ARMOUR-ZEN,来自BotriZen Ltd.,NZ),粉红粘帚霉(*Clonostachys rosea*)f.catenulata,也命名为链孢粘帚霉(*Gliocladium catenulatum*)(例如分离株J1446:**PRESTOP**[®],来自Verdera,芬兰),盾壳霉(*Coniothyrium minitans*)(例如**CONTANS**[®],来自Prophyta,德国),寄生内座壳(*Cryphonectria parasitica*)(例如寄生内座壳(*Endothia parasitica*),来自CNICM,法国),浅白隐球菌(*Cryptococcus albidus*)(例如**YIELD PLUS**[®],来自Anchor Bio-Technologies,南非),尖孢镰孢(*Fusarium oxysporum*)(例如**BIOFOX**[®],来自S.I.A.P.A.,意大利,**FUSACLEAN**[®],来自Natural Plant Protection,法国),*Metschnikowia fructicola*(例如**SHEMER**[®],来自Agrogreen,以色列),双孢微托菌(*Microdochium dimerum*)(例如**ANTIBOT**[®],来自Agrauxine,法国),*Phlebiopsis gigantea*(例如**ROTSOP**[®],来自Verdera,芬兰),*Pseudozyma flocculosa*(例如**SPORODEX**[®],来自Plant Products Co.Ltd.,加拿大),寡雄腐霉(*Pythium oligandrum*)DV74(例如**POLYVERSUM**[®],来

自Remeslo SSR0,Biopreparaty,Czech Rep.),Reynoutria sachlinensis(例如**REGALIA**[®],来自Marrone BioInnovations,USA),黄色蠕形霉(Talaromyces flavus)V117b(例如**PROTUS**[®],来自Prophyta,德国),蛭草木霉(Trichoderma asperellum)SKT-1(例如**ECO-HOPE**[®],来自Kumiai Chemical Industry Co.,Ltd.,Japan),深绿木霉(T.atroviride)LC52(例如**SENTINEL**[®],来自Agrimm Technologies Ltd,NZ),哈茨木霉(T.harzianum)T-22(例如**PLANTSHIELD**[®],来自Firma BioWorks Inc.,USA),哈茨木霉(T.harzianum)TH 35(例如根**PRO**[®],来自Mycontrol Ltd.,以色列),哈茨木霉(T.harzianum)T-39(例如**TRICHODEX**[®]和**TRICHODERMA 2000**[®],来自Mycontrol Ltd.,以色列和Makhteshim Ltd.,以色列),哈茨木霉(T.harzianum)和绿色木霉(T.viride)(例如**TRICHOPEL**,来自Agrimm Technologies Ltd,NZ),哈茨木霉(T.harzianum)ICC012和绿色木霉(T.viride)ICC080(例如**REMEDIER**[®]WP,来自Isagro Ricerca,意大利),多孢木霉(T.polysporum)和哈茨木霉(T.harzianum)(例如**BINAB**[®],来自BINAB Bio-Innovation AB,瑞典),钩木霉(T.stromaticum)(例如**TRICOVAB**[®],来自C.E.P.L.A.C.,巴西),绿木霉(T.virens)GL-21(例如**SOILGARD**[®],来自Certis LLC,USA),绿色木霉(T.viride)(例如**TRIECO**[®],来自Ecosense Labs.(印度)Pvt.Ltd.,Indien,**BIO-CURE**[®]F,来自T.Stanes&Co.Ltd.,Indien),绿色木霉(T.viride)TV1(例如绿色木霉(T.viride)TV1,来自Agribiotec srl,意大利),奥德曼细基格孢(Ulocladium oudemansii)HRU3(例如**BOTRY-ZEN**[®],来自Botry-Zen Ltd,NZ)。

[1237] 上文类型F的可商购化合物II可以参见The Pesticide Manual,15th Edition,C.D.S.Tomlin,British Crop Protection Council(2011)以及其它出版物。它们的制备和它们对有害真菌的活性是已知的(参见:<http://www.alanwood.net/pesticides/>);这些物质是可商购的。用IUPAC命名描述化合物,其制备及其杀真菌活性也是已知的(参见Can.J.Plant Sci.48(6),587-94,1968;EP A 141 317;EP-A 152 031;EP-A 226 917;EP A 243 970;EP A 256 503;EP-A 428 941;EP-A 532 022;EP-A 1 028 125;EP-A 1 035 122;EP A 1 201 648;EP A 1 122 244,JP 2002316902;DE 19650197;DE 10021412;DE 102005009458;US 3,296,272;US 3,325,503;WO 98/46608;WO 99/14187;WO 99/24413;WO 99/27783;WO 00/29404;WO 00/46148;WO 00/65913;WO 01/54501;WO 01/56358;WO 02/22583;WO 02/40431;WO 03/10149;WO 03/11853;WO 03/14103;WO 03/16286;WO 03/53145;WO 03/61388;WO 03/66609;WO 03/74491;WO 04/49804;WO 04/83193;WO 05/120234;WO 05/123689;WO 05/123690;WO 05/63721;WO 05/87772;WO 05/87773;WO 06/15866;WO 06/87325;WO 06/87343;WO 07/82098;WO 07/90624,WO 11/028657)。

[1238] 可以将本发明化合物与土壤、泥炭或其它生根介质混合以保护植物对抗种子传播

的、土壤传播的或叶的真菌病害。

[1239] 适宜用于组合物中的增效剂的实例包括增效醚、增效散、safroxan和十二烷基咪唑。

[1240] 包括在组合物中的适宜除草剂和植物生长调节剂取决于希望目标和所需效果。

[1241] 可包括的稻选择性除草剂的实例是敌稗。用于棉花中的植物生长调节剂的实例是PIX™。

[1242] 某些混合物可以包含具有显著不同的物理、化学或生物学特性的活性成分，所述特性使得它们不容易地一起配制。

[1243] 通过本领域已知的任何施用方法，能够将无脊椎动物病虫害（也称为“动物病虫害”）即昆虫、蛛形动物和线虫、其中植物生长或可以生长的植物、土壤或水与本发明化合物或包含它们的组合物接触。此处“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病虫害或植物上——一般是植物的叶子、茎干或根）和间接接触（将化合物/组合物施用至无脊椎动物病虫害或植物的处所）。

[1244] 通过使植物/作物接触农药有效量的本发明化合物，本发明化合物或包含它们的农药组合物可以用来保护生长中的植物和作物免于动物病虫害、特别是昆虫、螨虫（acaridae）或蛛形动物侵袭或侵染。术语“作物”指生长中的和收获的作物。

[1245] 本发明化合物和包含它们的组合物在防治各种栽培植物上的多种昆虫是特别重要的，所述植物是比如禾谷类，根用作物，油料作物，蔬菜，香料作物，观赏植物，例如硬粒小麦和其它小麦，大麦，燕麦，黑麦，玉米（饲料玉米和糖用玉米/甜玉米和饲用玉米），大豆，油状物作物，十字花科植物，棉花，向日葵，香蕉，稻，油籽油菜，芜菁油菜，糖用甜菜，饲料甜菜，茄子，马铃薯，禾本科草，草坪，草皮，饲料禾本科草，番茄，韭葱，南瓜/南瓜，卷心菜，冰山（iceberg）莴苣，胡椒，黄瓜，甜瓜，芸苔属（Brassica）的种，甜瓜，菜豆，豌豆，蒜，洋葱，胡萝卜，块茎植物比如马铃薯，甘蔗，烟草，葡萄，矮牵牛，老鹳草/天竺葵，三色堇和凤仙花。

[1246] 本发明化合物原样使用或者以组合物形式使用：将昆虫或待保护以免受昆虫侵袭的植物、植物繁殖材料比如种子，土壤，表面，物质或房间用杀昆虫有效量的活性化合物处理。所述施用能够在昆虫感染植物、植物繁殖材料比如种子、土壤、表面、物质或房间之前和在其之后进行。

[1247] 此外，无脊椎动物病虫害可以通过使靶标病虫害、其食物来源、生境、育种地或其处所接触农药有效量的本发明化合物来防治。如此，该施用可以在病虫害侵染处所、生长作物或已收获的作物之前或之后进行。

[1248] 本发明化合物还能够预防性地施用至预期会出现病虫害的场所。

[1249] 本发明化合物也可以通过将植物与农药有效量的本发明化合物接触以用来保护生长中的植物免受病虫害侵袭或侵染。如此，“接触”包括直接接触（将化合物/组合物直接施用至病虫害和/或植物上——一般至植物的种子、叶子、茎干或根上）和间接接触（将化合物/组合物施用至病虫害和/或植物的处所）。

[1250] “处所”意指其中正生长或可以生长病虫害或寄生物的生境、产卵场、植物、种子、土壤、区域、材料或环境。

[1251] 通常，“农药有效量”意指对生长实现可观察效果的所需活性分量，所述效果包括坏死，死亡，阻滞，预防，和移除，消灭，或者减少靶标生物的出现和活动。对于本发明中所

用的不同化合物/组合物来说农药有效量可以变化。所述组合物的农药有效量也会根据主要的条件比如希望的农药效果和持续期、天气、靶标物种、处所、施用模式等而变化。

[1252] 在土壤处理或施用至病虫害栖息地或巢穴的情况下,活性成分的量是0.0001至500g每100m²,优选0.001至20g每100m²。

[1253] 在材料保护中的常规施用率是,例如0.01g至1000g活性化合物每m²经处理的材料,希望的是0.1g至50g每m²。

[1254] 在浸渍材料中所用的杀昆虫组合物一般含有0.001至95重量%,优选0.1至45重量%,更优选1至25重量%的至少一种驱避剂和/或杀昆虫剂。

[1255] 用于处理栽培作物中时,本发明活性成分的施用率可以是0.1g至4000g每公顷,希望的是5g至500g每公顷,更希望的是5g至200g每公顷。

[1256] 本发明化合物通过接触(经由土壤、玻璃、墙壁、床帐、地毯、植物部分或动物部分)和摄食(饵剂或植物部分)都是有效的。

[1257] 本发明化合物还可以施用以对抗非作物昆虫病虫害,比如蚂蚁、白蚁、蜂、蝇、蚊、蟋蟀或蟑螂。为了用于对抗所述非作物病虫害,本发明化合物优选在饵剂组合物中使用。

[1258] 所述饵剂能够是液体、固体或半固体制剂(例如凝胶)。固体饵剂能够形成适合各自施用的不同形状和形式,例如颗粒、块料、棒、盘。液体饵剂能够充入不同设备,例如开放的容器、喷雾设备、滴液来源或蒸发源以保证合适的施用。凝胶可以基于含水或含油的基质并且能够将其配制以应对有关粘性、水分保持或老化特征具体需要。

[1259] 组合物所用的饵剂是吸引力足以引诱昆虫比如蚂蚁、白蚁、蜂、蝇、蚊、蟋蟀等或蟑螂将其吞食的产品。所述吸引力可以通过使用摄食刺激剂或性引诱素来操纵。食物刺激剂不受限制地选自,例如动物和/或植物蛋白(肉-、鱼-或血粉,昆虫部分,蛋黄),动物和/或植物来源的脂肪和油,或单-、寡-或多有机糖,特别是蔗糖,乳糖,果糖,右旋糖,葡萄糖,淀粉,果胶或甚至糖蜜或蜜。水果的新鲜或腐败部分,作物,植物,动物,昆虫或其具体部分也可以充当摄食刺激剂。性引诱素已知对昆虫更具特异性。具体的引诱素描述于文献中且为本领域技术人员所已知。

[1260] 为了用于饵剂组合物,活性成分的典型含量是0.001重量%至15重量%,合意地是0.001重量%至5%重量%的活性成分。

[1261] 作为气雾剂(例如在喷雾罐中),油类喷雾剂或泵喷雾剂的本发明化合物配制剂对非专业用户防治病虫害比如蝇、蚤、蜚、蚊或蟑螂是高度适宜的。气雾剂配方优选包含所述活性化合物;溶剂比如低级醇(例如甲醇,乙醇,丙醇,丁醇),酮(例如丙酮,甲基乙基酮),具有大约50至250°C沸腾范围的烷烃(例如煤油),二甲基甲酰胺,N-甲基吡咯烷酮,二甲亚砜,芳族烃比如甲苯、二甲苯,水;还有辅剂比如乳化剂,比如山梨糖醇单油酸酯,具有3-7mol环氧乙烷的油烯基乙氧基化物,脂肪醇乙氧基化物,芳香油比如精油,中级脂肪酸与低级醇的酯,芳族羰基化合物;如果合适时,稳定剂比如苯甲酸钠,两性表面活性剂,低级环氧化物,原甲酸三乙基酯以及如果需要时,推进剂比如丙烷、丁烷、氮、经压缩的空气、二甲基醚、二氧化碳、一氧化二氮或这些气体的混合物。

[1262] 所述油类喷雾配制剂与气雾剂配方的区别是不使用推进剂。

[1263] 用于喷雾组合物中时,活性成分的含量是0.001至80重量%,优选0.01至50重量%和最优选0.01至15重量%。

[1264] 本发明化合物及其各自的组合物还能够用于蚊香和熏香,烟弹,蒸发器板或长期蒸发器中,以及防蛀纸,防蛀垫或其它热-独立的蒸发器系统中。

[1265] 用本发明化合物及其各自的组合物防治昆虫传播的传染性疾病(例如疟疾、登革热和黄热病、淋巴丝虫病和利什曼病)的方法也包括处理屋舍表面,空气喷雾和浸渗帘幕、帐幕、衣物、床帐、捕蝇器等。用于施用至纤维、织物、针织物、无纺布物、网材料或箔材和帆布的杀昆虫组合物优选包含混合物,其包括杀昆虫剂、任选地驱避剂和至少一种粘合剂。适宜的驱避剂例如是N,N-二乙基-间-甲苯酰胺(DEET),N,N-二乙基苯基乙酰胺(DEPA),1-(3-环己烷-1-基-羰基)-2-甲基胡椒碱(piperine),(2-羟基甲基环己基)乙酸内酯,2-乙基-1,3-己二醇,避蚊酮,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-菊酸酯(Esbiothrin),衍生自或相当于植物提取物的驱避剂如柠檬烯,丁香酚,(+)-Eucamalol(1),(-)-1-表-eucamalol或来自植物比如斑皮桉(*Eucalyptus maculata*),单叶蔓荆(*Vitex rotundifolia*),*Cymbopogon martinii*,香茅(*Cymbopogon citratus*)(柠檬茅),亚香茅(*Cymbopogon nardus*)(香茅)的粗植物提取物。适宜的粘合剂例如选自下述物质的聚合物和共聚物:脂族酸乙烯酯(比如乙酸乙烯酯和叔羧酸乙烯酯),醇的丙烯酸和甲基丙烯酸酯,比如丙烯酸丁酯,丙烯酸2-乙基己基酯,和丙烯酸甲酯,一-和二-烯型不饱和的烃,比如苯乙烯,和脂族二烯,比如丁二烯。

[1266] 窗帘和床帐的浸渍通常通过将织物材料浸入杀昆虫剂的乳液或分散液或将其喷雾至所述织物上来完成。

[1267] 本发明化合物及其组合物能够用于保护木质材料比如树木、木栅栏、枕木等和建筑比如房屋,附属建筑,工厂,以及建筑材料,家具,皮革,纤维,乙烯基类制品,电线和缆线等免受蚂蚁和/或白蚁侵袭,和用于防治蚂蚁和白蚁使其不对作物或人类(例如当所述病虫害侵入房屋和公共设施中时)造成伤害。本发明化合物不仅施用至周围土壤表面或施用入地板下的土壤以保护木质材料,而且其还能够施用至木材化物品比如地板下的水泥表面,壁橱柱,屋梁,层板,家具等,木质物品比如木屑板,半板(half boards)等和乙烯基类制品比如包裹的电线,乙烯基片材,绝热材料比如苯乙烯泡沫等。在施用以抗击对作物或人类造成伤害的蚂蚁的情况下,将本发明的蚂蚁防治剂施用至所述作物或周围土壤,或直接施用至蚂蚁等的巢穴。

[1268] 本发明化合物也适于处理植物繁殖材料、特别是种子,以保护它们免受昆虫病虫害、尤其是土栖昆虫病虫害侵袭,和所获得的植物根和茎枝对抗土壤病虫害和叶面昆虫。

[1269] 本发明化合物特别有用地保护种子免受土壤病虫害侵袭和所得的植物根和茎枝对抗土壤病虫害和叶面昆虫。优选的是保护所得植物的根和茎枝。更优选的是保护所得植物的茎枝免于穿刺和吮吸昆虫侵袭,其中保护其免于蚜虫侵袭是最优选的。

[1270] 因此,本发明包括保护种子免受昆虫尤其是土壤昆虫侵袭以及幼苗的根和茎枝免受昆虫尤其是土壤和叶面昆虫侵袭的方法,所述方法包括将种子在播种之前和/或在催芽之后与本发明化合物或者其盐接触。尤其优选这样的方法,其中保护植物的根和茎枝;更优选这样的方法,其中保护植物茎枝免于穿刺和吮吸昆虫侵袭;最优选这样的方法,其中保护植物茎枝免于蚜虫侵袭。

[1271] 术语种子涵盖全部种类的种子和植物繁殖体,包括但不限于真种子,种块,根蘖,谷物,鳞茎,果实,块茎,谷粒,插条,伐条等,而在优选实施方式中意指真种子。

[1272] 术语种子处理剂包含本领域已知的全部适宜的种子处理剂技术,比如种衣剂、种子涂层、种子喷粉、种子浸泡和种子制粒。

[1273] 本发明也包含含有活性化合物的种子包衣。

[1274] 术语“用…包衣和/或含有”通常是指所述活性成分在施用时绝大部分在繁殖产品的表面上,尽管取决于施用方法所述成分或多或少的部分可以渗入繁殖产品中。当(重新)栽培所述繁殖产品时,它可以吸收活性成分。

[1275] 适宜的种子是下述的种子:禾谷类,根用作物,油料作物,蔬菜,香料作物,观赏植物,例如硬粒小麦和其它小麦,大麦,燕麦,黑麦,玉米(饲料玉米和糖用玉米/甜玉米和饲用玉米),大豆,油料作物,十字花科植物,棉花,向日葵,香蕉,稻,油籽油菜,芜菁油菜,糖用甜菜,饲料甜菜,茄子,马铃薯,禾本科草,草坪,草皮,饲料禾本科草,番茄,韭葱,南瓜/南瓜,卷心菜,冰山(iceberg)莴苣,胡椒,黄瓜,甜瓜,芸苔属(*Brassica*)的种,甜瓜,菜豆,豌豆,蒜,洋葱,胡萝卜,块茎植物比如马铃薯,甘蔗,烟草,葡萄,矮牵牛,老鹳草/天竺葵,三色堇和风仙花。

[1276] 此外,活性化合物还可以用于处理来自植物的种子,所述植物由于包括基因工程改造方法的育种耐受除草剂或杀真菌剂或杀昆虫剂作用。

[1277] 例如,活性化合物能够用于处理来自植物的种子,所述植物抗选自磺酰脲类、咪唑啉酮、草铵膦或草甘膦-异丙基铵盐和类似的活性物质(参见例如,EP-A 242 236,EP-A 242 246)(WO 92/00377)(EP-A 257 993,U.S.5,013,659)的除草剂或者是转基因的栽培作物,例如棉花,其能够产生使植物抗某些病虫害的苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*)毒素(Bt毒素)(EP-A 142 924,EP-A 193 259)。

[1278] 另外,活性化合物也能用于处理来自植物的种子,所述植物具有与现有植物相比较经修饰的特征,它们能够例如通过传统育种方法和/或产生突变型或通过重组程序产生。例如,已描述了有关为改变植物中合成的淀粉而重组改变栽培作物(例如WO 92/11376,WO 92/14827,WO 91/19806)或者具有经改变的脂肪酸组成的转基因栽培作物(WO 91/13972)的许多情况。

[1279] 活性化合物的种子处理剂施用在播种植物之前和在植物出苗之前通过喷雾或通过喷粉种子进行。

[1280] 对种子处理特别有用的组合物是例如:

[1281] A 可溶性浓缩物(SL,LS)

[1282] D 乳液(EW,EO,ES)

[1283] E 悬浮液(SC,OD,FS)

[1284] F 水可分散性粒剂和水可溶性颗粒剂(WG,SG)

[1285] G 水可分散性粉剂和水可溶性粉剂(WP,SP,WS)

[1286] H 凝胶配制剂(GF)

[1287] I 粉剂(DP,DS)

[1288] 常规的种子处理配制剂包括例如种子处理悬浮剂FS,种子处理液剂LS,种子处理干粉剂DS,种子处理可分散粉剂WS,种子处理可溶粉剂SS和种子处理乳剂ES和EC以及凝胶剂GF。这些配制剂能够稀释地或未稀释地施用至种子。向种子的施用在播种之前直接在种子上进行或在已催芽后者之后进行。

[1289] 在优选实施方式中,将FS配制剂用于种子处理。一般地,FS配制剂可以包含1-800g/l活性成分,1-200g/l表面活性剂,0至200g/l抗冻剂,0至400g/l粘合剂,0至200g/l颜料和多至1升溶剂,优选水。

[1290] 用于种子处理特别优选的本发明化合物的FS配制剂通常包含0.1至80%重量(1至800g/l)活性成分,0.1至20%重量(1至200g/l)的至少一种表面活性剂,例如0.05至5%重量润湿剂和0.5至15%重量分散剂,多至20%重量,例如5至20%的抗冻剂,0至15%重量,例如1至15%重量的颜料和/或染料,0至40%重量,例如1至40%重量的粘合剂(粘着剂/粘附剂),任选地多至5%重量,例如0.1至5%重量的增稠剂,任选地0.1至2%消泡剂,和任选地防腐剂比如杀生物剂,抗氧化剂等,例如0.01至1%重量的量,以及填料/赋形剂,多至100%重量。

[1291] 另外,种子处理配制剂还可以包含粘合剂和任选地着色剂。

[1292] 可以加入粘合剂以改善处理之后活性材料在种子上的粘附。适宜的粘合剂是氧化烯烃比如环氧乙烷或环氧丙烷的均聚物和共聚物,聚乙酸乙烯酯,聚乙烯醇,聚乙烯基吡咯烷酮,及其共聚物,乙烯-乙酸乙烯酯共聚物,丙烯酸的均聚物和共聚物,聚乙烯胺,聚乙烯酰胺和聚乙烯亚胺,多糖比如纤维素、甲基纤维素和淀粉,聚烯烃均聚物和共聚物比如烯烃/马来酸酐共聚物,聚氨酯,聚酯,聚苯乙烯均聚物和共聚物。

[1293] 任选地,还可以将着色剂包括入配制剂中。种子处理配制剂的适宜着色剂或染料是罗丹明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,颜料褐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。

[1294] 胶凝剂的实例是角叉菜(**Satiagel[®]**)

[1295] 在种子处理中,本发明化合物的施用量通常是0.01g至10kg每100kg种子,优选0.05g至5kg每100kg种子,更优选0.1g至1000g每100kg种子,尤其是1g至200g每100kg种子。

[1296] 因此,本发明也涉及种子,其包含本发明化合物、包括如本文所定义的其农业上有用的盐。本发明化合物、包括其农业上有用的盐的量通常是0.01g至10kg每100kg种子,优选0.05g至5kg每100kg种子,尤其是0.1g至1000g每100kg种子。对于特定作物比如莴苣用量可以更高。

[1297] 原则上,能够用来处理种子的方法全部是适宜的种子处理剂和特别是本领域已知的种衣剂技术,比如种子包衣(例如种子制粒)、种子喷粉和种子浸渗(例如种子浸泡)。在此处,“种子处理剂”是指使种子和本发明化合物相互接触的全部方法,和“种衣剂”是指为种子提供一定量本发明化合物、也即产生包含本发明化合物的种子的种子处理方法。原则上,处理剂能够在从收获种子到播种种子的任意时间施用至种子。种子能够临种植种子之前或在种植种子期间处理,例如采用“种植者容器(planter's box)”方法。然而,处理还可以在种植种子之前进行数周或数月、例如多至12个月,例如以种衣剂处理形式进行,基本上未观察到效力降低。

[1298] 方便地,处理剂施用至未播种的种子。如本文所用,术语“未播种的种子”意在包含从收获种子至播种种子于地面中以发芽和生长植物的任意时间段的种子。

[1299] 特别地,处理按程序进行,其中在适宜装置、例如用于固体或固体/液体混合伴侣

的混合装置中将种子与所希望量的原样或在事先用水稀释之后的种子处理配制剂混合,直至组合物均匀分布在种子上。如果适当,随后进行干燥步骤。

[1300] 本发明化合物,包括其立体异构体、兽医学上可接受的盐或N-氧化物,也尤其适于用来抗击动物体内和体表的寄生物。

[1301] 因此,本发明目的也是提供防治动物体内和体表寄生物的新方法。本发明的又一目的是提供用于动物的更安全的农药。本发明的又一目的还是提供用于动物的农药,其可以以比现有农药更低的剂量使用。另外,本发明的又一目的是提供用于动物的农药,其提供对寄生物的长期残余防治。

[1302] 本发明也涉及用于抗击动物体内和体表的寄生物的组合,其包含杀寄生物有效量的本发明化合物、包括其立体异构体、兽医学上可接受的盐或N-氧化物,和可接受的载体。

[1303] 本发明也提供用于处理、防治、预防和保护动物对抗寄生物侵染和感染的方法,其包括经口、局部或经肠胃外向动物给予或施用杀寄生物有效量的本发明化合物、包括其立体异构体、兽医学上可接受的盐或N-氧化物,或包含其的组合。

[1304] 本发明也提供本发明化合物、包括其立体异构体、兽医学上可接受的盐或N-氧化物,用于处理或保护动物免于无脊椎动物病虫害侵染或感染的用途。

[1305] 本发明也提供制备组合物的方法,所述组合物用于处理、防治、预防或保护动物对抗寄生物侵染或感染,其包含杀寄生物有效量的本发明化合物、包括其立体异构体、兽医学上可接受的盐或N-氧化物,或包含其的组合。

[1306] 化合物对农业病虫害的活性不表明它们防治动物体内和体表的内寄生物和外寄生物的适用性,所述防治需要例如在口服施用情况下的低的、非催吐剂量,与动物的代谢相容性,低毒性和安全处理。

[1307] 令人惊讶地,目前发现式(I)化合物及其立体异构体、兽医学上可接受的盐、互变异构体和N-氧化物适于抗击动物体内和体表的内寄生物和外寄生物。

[1308] 本发明化合物,特别是式(I)化合物及其立体异构体、兽医学上可接受的盐、互变异构体和N-氧化物,和包含它们的组合物优选用于防治和预防动物的侵袭和动物中的感染,所述动物包括温血动物(包括人类)和鱼类。它们例如适于防治和预防哺乳动物中的侵袭和感染,所述哺乳动物是比如牛,绵羊,猪,骆驼,鹿,马,猪,家禽,兔子,山羊,狗和猫,水牛,驴,扁角鹿和驯鹿,以及裘皮用动物比如水貂、毛丝鼠和浣熊,鸟类比如鸡、鹅、火鸡和鸭和鱼比如淡水和咸水鱼比如鳟鱼、鲤鱼和鳗鱼。

[1309] 本发明化合物、包括其立体异构体、兽医学上可接受的盐或N-氧化物,和包含它们的组合物优选用于防治和预防家畜比如狗或猫中的侵袭和感染。

[1310] 温血动物和鱼中的侵袭包括但不限于虱,叮咬虱,蜱,羊鼻蝇蛆,羊蜱蝇,螫蝇,家蝇,蝇,蛆蝇(myiasitic fly)幼虫,恙螨,蚋,蚊和蚤。

[1311] 本发明化合物、包括其立体异构体、兽医学上可接受的盐或N-氧化物,和包含它们的组合物适于全身性和/或非全身性防治外寄生物和/或内寄生物。它们对全部或某些发展阶段有活性。

[1312] 本发明化合物特别有用地分别抗击下述目和种的寄生物:

[1313] 蚤(蚤目(Siphonaptera)),例如猫栉首蚤(*Ctenocephalides felis*),犬栉首蚤

(*Ctenocephalides canis*), 印鼠客蚤(*Xenopsylla cheopis*), 人蚤(*Pulex irritans*), 穿皮潜蚤(*Tunga penetrans*), 和具带病蚤(*Nosopsyllus fasciatus*),

[1314] 蟑螂(蜚蠊目(*Blattaria*)-蜚蠊目(*Blattodea*)), 例如德国小蠊(*Blattella germanica*), *Blattella asahinae*, 美洲大蠊(*Periplaneta americana*), 日本大蠊(*Periplaneta japonica*), 褐斑大蠊(*Periplaneta brunnea*), 黑胸大蠊(*Periplaneta fuliginosa*), 澳洲大蠊(*Periplaneta australasiae*), 和东方蜚蠊(*Blatta orientalis*),

[1315] 蝇, 蚊(双翅目(*Diptera*)), 例如埃及伊蚊(*Aedes aegypti*), 白条伊蚊(*Aedes albopictus*), 刺扰伊蚊(*Aedes vexans*), 墨西哥按实蝇(*Anastrepha ludens*), 五斑按蚊(*Anopheles maculipennis*), *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, 冈比亚按蚊(*Anopheles gambiae*), *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, 微小按蚊(*Anopheles minimus*), 四斑按蚊(*Anopheles quadrimaculatus*), 红头丽蝇(*Calliphora vicina*), 蛆症金蝇(*Chrysomya bezziana*), *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, 嗜人锥蝇(*Cochliomyia hominivorax*), 噬人瘤蝇(*Cordylobia anthropophaga*), *Culicoides furens*, 尖音库蚊(*Culex pipiens*), *Culex nigripalpus*, 致倦库蚊(*Culex quinquefasciatus*), *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, 人肤蝇(*Dermatobia hominis*), 夏厕蝇(*Fannia canicularis*), 肠胃蝇(*Gasterophilus intestinalis*), 刺舌蝇(*Glossina morsitans*), 须舌蝇(*Glossina palpalis*), 棕足舌蝇(*Glossina fuscipes*), 拟寄舌蝇(*Glossina tachinoides*), 西方角蝇(*Haematobia irritans*), 鞍瘕蚊(*Haplodiplosis equestris*), *Hippelates* spp., *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*, 铜绿蝇(*Lucilia cuprina*), 丝光绿蝇(*Lucilia sericata*), *Lycoria pectoralis*, 曼蚊属(*Mansonia* spp.), 家蝇(*Musca domestica*), 厩腐蝇(*Muscina stabulans*), 羊狂蝇(*Oestrus ovis*), 银足白蛉(*Phlebotomus argentipes*), *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, 赤尾麻蝇(*Sarcophaga haemorrhoidalis*), 麻蝇属(*Sarcophaga* sp.), *Simulium vittatum*, 厩螫蝇(*Stomoxys calcitrans*), 嗜牛虻(*Tabanus bovinus*), *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, 和 *Tabanus similis*,

[1316] 虱(虱目(*Phthiraptera*)), 例如头虱(*Pediculus humanus capitis*), *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, 牛血虱(*Haematopinus eurysternus*), 猪血虱(*Haematopinus suis*), 牛颞虱(*Linognathus vituli*), *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, 雏鸡羽虱(*Menacanthus stramineus*) 和牛管虱(*Solenopotes capillatus*)。

[1317] 蜱和寄生螨(寄螨目(*Parasitiformes*)): 蜱(*Ixodida*), 例如 *Ixodes scapularis*, 全环硬蜱(*Ixodes holocyclus*), *Ixodes pacificus*, 血红扇头蜱(*Rhipicephalus sanguineus*), 安氏革蜱(*Dermacentor andersoni*), 变异革蜱(*Dermacentor variabilis*), 美洲花蜱(*Amblyomma americanum*), 有斑花蜱(*Amblyomma maculatum*), *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* 和寄生螨(中气门亚目(*Mesostigmata*)), 例如柏氏禽刺螨(*Ornithonyssus bacoti*) 和鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*),

[1318] 辐螨亚目(*Actinedida*)(前气门亚目(*Prostigmata*)) 和粉螨目(*Acaridida*)(无气

门亚目(Astigmata))例如蜂跗线螨属(*Acarapis* spp.),姬螯螨属(*Cheyletiella* spp.),禽螯厘螨属(*Ornithocheyletia* spp.),肉螨属(*Myobia* spp.),疮螨属(*Psorergates* spp.),蠕形螨属(*Demodex* spp.),恙螨属(*Trombicula* spp.),牦螨属(*Listrophorus* spp.),粉螨属(*Acarus* spp.),食酪螨属(*Tyrophagus* spp.),嗜木螨属(*Caloglyphus* spp.),颈下螨属(*Hypodectes* spp.),翅螨属(*Pterolichus* spp.),瘙螨属(*Psoroptes* spp.),痒螨属(*Chorioptes* spp.),耳螨属(*Otodectes* spp.),疥螨属(*Sarcoptes* spp.),痂螨属(*Notoedres* spp.),疙螨属(*Knemidocoptes* spp.),胞螨属(*Cytodites* spp.),和皮膜螨属(*Laminosioptes* spp.),

[1319] 蝱虫(异翅亚目(Heteropterida)):温带臭虫(*Cimex lectularius*),热带臭虫(*Cimex hemipterus*),*Reduvius senilis*,椎猎蝱属(*Triatoma* spp.),红猎蝱属(*Rhodnius* spp.),全圆蝱属(*Panstrongylus* spp.)和齿背猎蝱(*Arilus critatus*),

[1320] 虱目(Anoplurida),例如血虱属(*Haematopinus* spp.),长颚虱属(*Linognathus* spp.),人虱属(*Pediculus* spp.),阴虱属(*Phthirus* spp.),和管虱属(*Solenopotes* spp.),

[1321] 食毛目(Mallophagida)(亚目Arnblycerina和Ischnocerina),例如毛羽虱属(*Trimenopon* spp.),*Menopon* spp.,巨羽虱属(*Trinoton* spp.),牛羽虱属(*Bovicola* spp.),*Werneckiella* spp.,*Lepikentron* spp.,嚼虱属(*Trichodectes* spp.),和猫羽虱属(*Felicola* spp.),

[1322] 线虫(roundworms)线虫纲(Nematoda):

[1323] 鞭虫(wipeworms)和Trichinosis(*Trichosyringida*),例如毛线虫科(*Trichinellidae*)(毛线虫属(*Trichinella* spp.)),(毛首科(*Trichuridae*))鞭虫属(*Trichuris* spp.),毛细线虫属(*Capillaria* spp.),

[1324] 小杆线虫目(Rhabditida),例如小杆线虫属(*Rhabditis* spp.),类圆线虫属(*Strongyloides* spp.),*Helicephalobus* spp.,

[1325] Strongylida,例如圆线虫属(*Strongylus* spp.),钩口线虫属(*Ancylostoma* spp.),*Necator americanus*,仰口线虫属(*Bunostomum* spp.)(钩虫),毛圆线虫属(*Trichostrongylus* spp.),捻转血矛线虫(*Haemonchus contortus*),奥斯特线虫属(*Ostertagia* spp.),古柏线虫属(*Cooperia* spp.),细颈线虫属(*Nematodirus* spp.),网尾属(*Dictyocaulus* spp.),*Cyathostoma* spp.,结节线虫属(*Oesophagostomum* spp.),*Stephanurus dentatus*,*Ollulanus* spp.,夏伯特线虫属(*Chabertia* spp.),*Stephanurus dentatus*,*Syngamus trachea*,钩口线虫属(*Ancylostoma* spp.),钩虫属(*Uncinaria* spp.),球头属(*Globocephalus* spp.),板口线虫属(*Necator* spp.),后圆线虫属(*Metastrongylus* spp.),*Muellerius capillaris*,原圆属(*Protostrongylus* spp.),*Angiostrongylus* spp.,*Parelaphostrongylus* spp.,*Aleurostrongylus abstrusus*,和*Dioctophyma renale*,

[1326] 肠线虫(蛔虫目(Ascaridida)),例如人蛔虫(*Ascaris lumbricoides*),*Ascaris suum*,*Ascaridia galli*,*Parascaris equorum*,蛲虫(*Enterobius vermicularis*)(蛲虫),*Toxocara canis*,*Toxascaris leonine*,斯氏虫属(*Skrjabinema* spp.),和*Oxyuris equi*,

[1327] 驼形目(Camallanida),例如*Dracunculus medinensis*(麦地那龙线虫)

[1328] 旋尾目(Spirurida),例如吸吮线虫属(*Thelazia* spp.)吴策属(*Wuchereria*

spp.),布鲁属(*Brugia* spp.),盘尾属(*Onchocerca* spp.),*Dirofilari* spp.,双瓣丝虫属(*Dipetalonema* spp.),狗尾草属(*Setaria* spp.),丝绒虫属(*Elaeophora* spp.),*Spirocerca lupi*,和胃线虫属(*Habronema* spp.),

[1329] 具刺头蠕虫(棘头纲(*Acanthocephala*)),例如棘头虫属(*Acanthocephalus* spp.),*Macracanthorhynchus hirudinaceus*和结居棘头虫属(*Oncicola* spp.),

[1330] 真涡虫(扁蠕虫类(*Plathelminthes*)):

[1331] 吸虫(吸虫纲(*Trematoda*)),例如*Faciola* spp.,*Fascioloides magna*,并殖吸虫属(*Paragonimus* spp.),双腔吸虫属(*Dicrocoelium* spp.),*Fasciolopsis buski*,*Clonorchis sinensis*,血吸虫属(*Schistosoma* spp.),毛血吸虫属(*Trichobilharzia* spp.),*Alaria alata*,并殖吸虫属(*Paragonimus* spp.),和*Nanocyetes* spp.,

[1332] *Cercomeromorpha*,尤其是真绦虫亚纲(*Cestoda*)(绦虫),例如裂头属(*Diphyllobothrium* spp.),*Tenia* spp.,棘球属(*Echinococcus* spp.),*Dipylidium caninum*,多头绦虫属(*Multiceps* spp.),膜壳属(*Hymenolepis* spp.),中殖孔属(*Mesocestoides* spp.),*Vampirolepis* spp.,蒙尼属(*Moniezia* spp.),裸头绦虫属(*Anoplocephala* spp.),*Sirometra* spp.,裸头绦虫属(*Anoplocephala* spp.),和膜壳属(*Hymenolepis* spp.)

[1333] 本发明涉及本发明化合物和包含它们的组合物用于防治和/或抗击动物体内和/或体表寄生物的治疗和非治疗用途。本发明化合物和包含它们的组合物可以通过将动物与杀寄生物有效量的本发明化合物和含有它们的组合物接触用来保护其免受寄生物侵袭或侵染。

[1334] 本发明化合物和包含它们的组合物能够通过接触(经由土壤,玻璃,壁,床帐,地毯,毡毯或动物部分)和摄食(例如饵料)均是有效的。“接触”本身包括直接接触(将含有本发明化合物的农药混合物/组合物直接施用在寄生物上,其可以包括在其处所-P间接接触,和也任选将农药混合物/组合物直接给予至待保护的动物上)和间接接触(将化合物/组合物施用至寄生物的处所)。通过向其处所施用接触寄生物是本发明化合物非治疗用途的实例。“处所-P”如上文所用意指寄生物在动物以外生长或可以生长的生境、食物来源、育种地、区域、物质或环境。

[1335] 通常,“杀寄生物有效量”意指对生长实现可观察效果的所需活性成分量,所述效果包括坏死,死亡,阻滞,预防,和移除,消灭,或者减少靶标生物的出现和活动。对本发明的各种化合物/组合物,杀寄生物有效量能够变化。杀寄生物有效量的组合物也将根据主要条件比如希望的杀寄生物效果和持续时间,靶标种类,施用模式等而变化。

[1336] 本发明化合物还能够预防性地施用至预期存在病虫害或寄生物的场所。

[1337] 给予能够预防地和治疗地进行。

[1338] 给予活性化合物直接或以适宜的制剂形式经口地、局部/皮肤地或经肠胃外地进行。

[1339] 本发明异噻唑啉化合物的保留性、生物蓄积性和/或毒性比现有技术化合物、特别是现有技术的异噻唑啉杀虫剂更低,所述现有技术化合物显示在土壤中的高持久性和从而在此蓄积。

实施例

[1340] 现在通过下述实施例进一步详细说明本发明,而非对其强加任何限制。

[1341] 制备实施例

[1342] 化合物能够例如通过偶联的高效液相色谱/质谱(HPLC/MS),通过¹H-NMR和/或通过其熔点来表征。

[1343] 分析型HPLC柱:

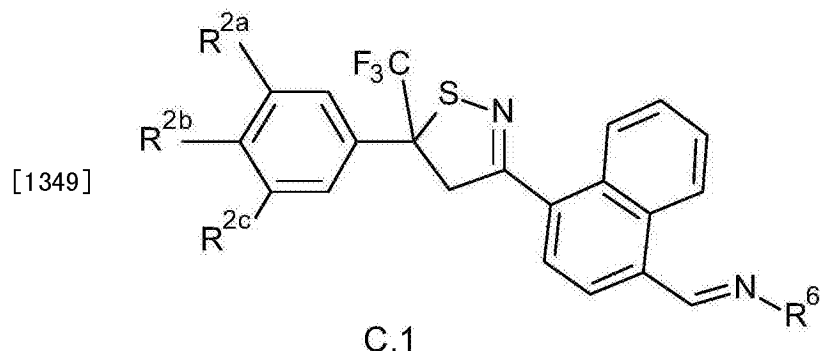
[1344] 方法A:分析型UPLC柱:Phenomenex Kinetex 1,7μm XB-C18100A;50x 2.1mm,来自Phenomenex,德国。洗脱:乙腈+0.1%三氟乙酸(TFA)/水+0.1%三氟乙酸(TFA),比率是5:95至100:0,在1.5分钟内,于60°C。流速:0.8mL/min至1mL/min,在1.5分钟内。MS-方法:ESI正模式。

[1345] ¹H-NMR:信号通过相对四甲基硅烷的化学位移(ppm,δ[delta])(CDCl₃用于¹³C-NMR),通过其多重度和其它其积分(提供相对氢原子数)表征。下述缩写用来表征信号多重度:m=多重峰,q=四重峰,t=三重峰,d=二重峰和s=单峰。

[1346] 所用缩写:d代表天(日),h代表小时,min代表分,r.t./室温代表20-25°C,THF代表四氢呋喃,OAc代表乙酸盐,HATU代表O-(7-氮杂苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲鎓六氟磷酸盐。

[1347] C.1化合物实施例1

[1348] 化合物实施例1-1至1-3相应于式C.1化合物:



[1350] 其中各合成化合物的R^{2a}, R^{2b}, R^{2c}, 和R⁶定义于下表C.1的一行。化合物类似于合成实施例S.1地合成。

[1351] 表C.1

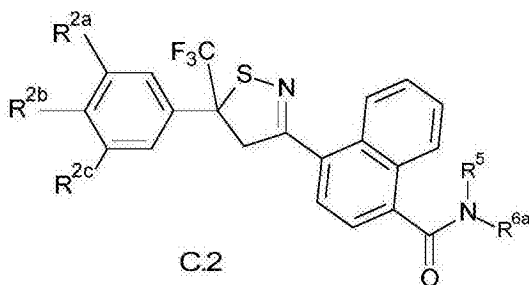
[1352]

Ex.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	-R ⁶	HPLC-MS: 方法, R _t (min) & [M+H] ⁺		
1-1	Cl, Cl, Cl	-NHC(=O)-NHCH ₂ CF ₃	A	1.561	629.1
1-2	Cl, Cl, Cl	-NHC(=O)-NHCH ₂ CCH	A	1.526	585.1
1-3	Cl, Cl, Cl	-NHC(=O)-NHCH ₂ CHF ₂	A	1.536	609.4

[1353] C.2化合物实施例2

[1354] 化合物实施例2-1至2-13相应于式C.2化合物:

[1355]

[1356] 其中各合成化合物的 R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} , R^5 , 和 R^{6a} 定义于下表C.2的一行。

[1357] 化合物类似于合成实施例S.2地合成。

[1358] 表C.2

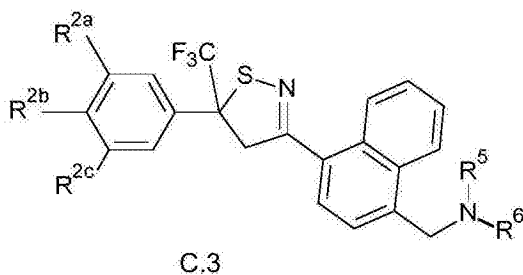
[1359]

Ex.	R^{2a} , R^{2b} , R^{2c}	R^5	$-R^{6a}$	HPLC-MS: 方法, R_t (min) & $[M+H]^+$		
2-1	Cl, Cl, Cl	H	$-\text{CH}_2-(3,3\text{-二氟环丁-1-基})$	A	1.524	608.9
2-2	Cl, Cl, Cl	H	$-\text{CH}_2-(1\text{-氟基-环丙-1-基})$	A	1.466	582.0
2-3	Cl, F, Cl	H	1-氟基-环丙-1-基	A	1.420	551.8
2-4	Cl, F, Cl	H	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	A	1.454	526.8
2-5	Cl, F, Cl	H	$\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NHCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	A	1.388	583.9
2-6	Cl, F, Cl	H	$\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NHCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	A	1.366	581.9
2-7	Cl, F, Cl	H	$\text{NH}-\text{C}(=\text{O})\text{NHCH}_2\text{CF}_3$	A	1.371	626.8
2-8	Cl, F, Cl	H	H	A	1.361	486.8
2-9	Cl, F, Cl	H	$\text{CH}_2\text{-环丙基}$	A	1.490	540.8
2-10	Cl, F, Cl	H	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	A	1.431	524.8
2-11	Cl, F, Cl	H	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	A	1.483	570.8
2-12	Cl, F, Cl	H	$\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NHCH}_2\text{(环丙基)}$	A	1.430	598.2
2-13	Cl, F, Cl	H	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S(O)}_2\text{CH}_2\text{(环丙基)}$	A	1.449	633.1

[1360] C.3化合物实施例3

[1361] 化合物实施例3-1至3-9相应于式C.3化合物:

[1362]

[1363] 其中各合成化合物的 R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} , R^5 , 和 R^6 定义于下表C.3的一行。

[1364] 化合物类似于合成实施例S.3地合成。

[1365] 表C.3

[1366]

Ex.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	R ⁵	-R ⁶	HPLC-MS: 方法, R _t (min) & [M+H] ⁺ 或 ¹ H NMR		
3-1	Br, H, CF ₃	H	C(=O)OC(CH ₃) ₃	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): δ8.3 (d, 1H), 8.1 (m, 2H), 7.9-7.7 (m, 3H), 7.7-7.5 (m, 3H), 4.9 (br. s, 1H), 4.8 (m, 2H), 4.4 (d, 1H), 4.1 (d, 1H), 1.5 (s, 9H)		
3-2	Br, H, CF ₃	H	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): δ8.0 (m, 2H), 7.9-7.75 (m, 3H), 7.65 (s, 1H), 7.4-7.3 (m, 2H), 6.9-6.8 (m, 1H), 4.45 (d, 1H), 4.3 (br. s, 2H), 4.05 (d, 1H)		
3-3	Br, H, CF ₃	H	C(=O)CH ₃	A	1.420	576.7
3-4	Br, H, CF ₃	H	C(=O)CH ₂ CH ₃	A	1.470	590.9
3-5	Br, H, CF ₃	H	C(=O)CH ₂ CF ₃	A	1.485	644.6
3-6	Br, H, CF ₃	H	C(=O)CH ₂ CH ₂ CH ₃	A	1.492	604.7
3-7	Br, H, CF ₃	H	C(=O)环丙基	A	1.474	600.9
3-8	Br, H, CF ₃	H	C(=O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	A	1.402	654.6
3-9	Br, H, CF ₃	H	C(=O)CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	A	1.427	668.6

[1367] 合成实施例S.1

[1368] 1-[(E)-[4-[5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噻唑-3-基]-1-萘基]亚甲基氨基]-3-(2,2,2-三氟乙基)脲

[1369] (化合物实施例1-1; 式IA化合物, 其中R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}是Cl, 而A是A¹=-CH[=N-NH-C(=O)-NH-CH₂CF₃])。

[1370] 步骤1: 4-溴萘-1-羧酸叔丁酯

[1371] 向4-溴萘-1-羧酸(50g, 0.2mol, CAS 16650-55-8)的甲苯(500mL)溶液加入SOCl₂(93g)。回流混合物过夜, 浓缩。粗制“酰氯”不加任何进一步纯化用于后续步骤。

[1372] 将粗制“酰氯”(0.2mol)的THF(500mL)溶液加至叔丁醇钾(33.6g)的THF(500mL)溶液, 和搅拌反应过夜。然后, 加水(500mL), 混合物用叔丁基-甲基醚(MTBE)(2x 1L)萃取。经合并的有机层用盐水洗涤(2x500mL), 干燥(Na₂SO₄), 过滤和浓缩, 提供粗制标题化合物(40g, 65%), 其不加任何进一步纯化用于后续步骤。

[1373] 步骤2: 4-乙酰基萘-1-羧酸叔丁酯

[1374] 在N₂下在回流下, 将在甲苯(300mL)中的步骤1粗制产物(18g), 三(二亚苄基丙酮)二钯(0) (“Pd₂(dba)₃”, 1.5g), 1,1'-联萘-2,2'-二基二(二苯基膦) (“BINAP”, 1.5g)和三丁基(1-乙氧基乙烯基)锡(54.2g)搅拌过夜。浓缩混合物, 将残余物溶于THF(100mL)和1M HCl水溶液(100mL)和在室温搅拌2小时。然后, 混合物用MTBE(2x 200mL)萃取, 经合并的有机层用盐水洗涤(2x100mL), 干燥(Na₂SO₄), 过滤和浓缩, 提供残余物, 将其通过快速色谱法在硅

胶上纯化,提供产物(12g,80%)。

[1375] ^1H NMR(400MHz, CDCl_3): δ 8.8(m, 1H), 8.6–8.5(m, 1H), 8.0(m, 1H), 7.8(m, 1H),

[1376] 7.7–7.6(m, 2H), 2.8(s, 3H), 1.7(s, 9H)。

[1377] 步骤3:4-[4,4,4-三氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-2-烯酰基]萘-1-羧酸叔丁酯

[1378] 向步骤2产物(4.3g)和2,2,2-三氟-1-(3,4,5-三氯苯基)乙酮(6.6g)的MTBE(100mL)和二甲基甲酰胺(DMF)混合物(50mL)溶液加入 $\text{Ca}(\text{OH})_2$ (0.98g)。在100℃搅拌反应过夜,用Dean-Stark设备除去形成的水。然后,浓缩混合物。加入水(50mL)和MTBE,有机层用盐水洗涤,干燥(Na_2SO_4),过滤和浓缩,提供残余物,将其通过快速色谱法在硅胶上纯化,提供产物(4g,48%)。

[1379] ^1H NMR(400MHz, CDCl_3): δ 8.7(m, 1H), 8.3(m, 1H), 7.9(d, 1H), 7.7–7.5(m, 2H), 7.3(m, 1H), 7.0(s, 2H, s), 1.7(s, 9H)。

[1380] 步骤4:4-[4,4,4-三氟-3-硫烷基-3-(3,4,5-三氯苯基)丁酰基]萘-1-羧酸叔丁酯

[1381] 将步骤3产物(19.1g, E/Z-异构体混合物)在 CH_2Cl_2 (250mL)中用三乙胺(19.1g)处理。在0℃,将气态硫化氢(H_2S)鼓泡通过溶液直至溶液饱和。在0℃再搅拌混合物1小时,然后用 CH_2Cl_2 (200mL)稀释。有机层用10%盐酸水溶液(3x)洗涤,干燥(Na_2SO_4),过滤,浓缩,提供粗制产物(10.6g, 定量),其不加任何进一步纯化用于后续步骤。

[1382] ^1H NMR(400MHz, CDCl_3): δ 8.8(d, 1H), 8.1(d, 1H), 8.0(d, 1H), 7.8–7.5(m, 5H), 4.3(d, 1H), 4.0(d, 1H), 3.3(s, 1H(SH)), 1.7(s, 9H)。

[1383] 步骤5:4-[5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噻唑-3-基]萘-1-羧酸叔丁酯

[1384] 在-15℃,将步骤4产物(10.6g)在 CH_2Cl_2 (200mL)中用三乙胺(7.6g)和用羟胺-O-磺酸(“HOSA”, 2.6g)的水(10mL)溶液处理。将反应温热至0℃,在0℃搅拌1小时,然后用 CH_2Cl_2 (300mL)稀释。有机层用饱和 NH_4Cl 水溶液(3x)洗涤,干燥(Na_2SO_4),过滤。向所得溶液,加入酸洗的分子筛(AW 300, 100g),在室温激烈地搅拌混合物3小时。然后,滤出分子筛,浓缩滤液,提供残余物,其通过研磨(乙酸乙酯/石油醚)纯化。所得产物(7.85g, 74%)不加任何进一步纯化用于后续步骤。

[1385] ^1H NMR(400MHz, CDCl_3): δ 8.8(d, 1H), 8.6(m, 1H), 8.0(d, 1H), 7.7–7.5(m, 3H), 7.4(s, 2H), 4.3(d, 1H), 4.1(d, 1H), 1.7(s, 9H)。

[1386] 步骤6:4-[5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噻唑-3-基]萘-1-羧酸

[1387] 在0℃,将步骤5产物(7.7g)在 CH_2Cl_2 (100mL)中用三氟乙酸(“TFA”, 50mL)处理,在室温搅拌混合物过夜。浓缩反应,与 CH_2Cl_2 (5x)共蒸,提供产物,是淡黄色固体(5.91g, 85%),其不加任何进一步纯化用于后续步骤。

[1388] ^1H NMR(400MHz, d_6 -DMSO): δ 8.9(m, 1H), 8.8(m, 1H), 8.2(m, 1H), 8.0(m, 1H), 7.9(s, 2H), 7.8–7.6(m, 2H), 7.4(s, 2H), 4.8–4.5(m, 2H)。

[1389] 步骤7:[4-[5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噻唑-3-基]-1-萘基]甲醇

[1390] 在室温向步骤6产物(2g)的 CH_2Cl_2 /甲苯(1:1, 20mL)溶液加入N,N-二甲基甲酰胺(“DMF”, 1滴)和草酰氯(1g)。在室温搅拌反应过夜,浓缩。残余物与 CH_2Cl_2 共蒸,不加任何进一步纯化用于后续步骤(1.8g, “酰氯”)。

[1391] 在0℃向“酰氯”(1.8g)的 CH_2Cl_2 (20mL)溶液加入氢化二异丁基铝的甲苯(1.5M,

6.2mL)溶液。在0℃搅拌所得溶液3小时,加入甲醇猝灭。加入罗谢尔盐(酒石酸钠钾,CAS 304-59-6)的饱和溶液,随后在室温搅拌激烈2小时。然后,加入CH₂Cl₂,有机层用水洗涤(2x),干燥(Na₂SO₄),过滤,浓缩。残余物通过快速色谱法(乙酸乙酯/环己烷)在硅胶上纯化,获得产物(1.05g,61%)。

[1392] ¹H NMR(400MHz,CDCl₃):δ8.9(m,1H),8.1(d,1H),7.7-7.6(m,4H)7.4(s,2H),5.2(s,2H),4.3(d,1H),4.1(d,1H)。

[1393] 步骤8:4-[5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噻唑-3-基]萘-1-甲醛

[1394] 在室温向步骤7产物(1.35g)的CH₂Cl₂(30mL)溶液加入Dess-Martin-高碘试剂(periodinane)(1.31g,CAS 87413-09-0)。搅拌反应过夜,过滤和浓缩。残余物通过快速色谱法(乙酸乙酯/环己烷)在硅胶上纯化,提供产物(0.78g,58%)。

[1395] ¹H NMR(400MHz,CDCl₃):δ10.5(s,1H),9.3(d,1H),8.6(d,1H),8.0(d,1H),7.8-7.6(m,3H),7.4(s,2H),4.3(d,1H),4.1(d,1H)。

[1396] 步骤9:1-[(E)-[4-[5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噻唑-3-基]-1-萘基]亚甲基氨基]-3-(2,2,2-三氟乙基)尿素

[1397] 在70℃将步骤8产物(0.2g)和1-铵-3-(2,2,2-三氟乙基)脲盐酸盐(70mg)的EtOH(5mL)和乙酸(1滴)溶液搅拌3小时,在室温过夜。然后,加入水和乙酸乙酯,分层。有机层用5%K₂CO₃水溶液洗涤,干燥(Na₂SO₄),浓缩。残余物通过快速色谱法(乙酸乙酯/环己烷)在硅胶上纯化,提供产物(0.12g,48%)。

[1398] ¹H NMR(400MHz,CDCl₃):δ8.9-8.7(m,2H),8.5(s,1H),8.3(m,1H),7.9(d,1H),7.7-7.6(m,3H),7.4(s,2H),6.5(m,1H),4.3(d,1H),4.2-4.0(m,3H)。

[1399] 合成实施例S.2

[1400] N-[(3,3-二氟环丁基)甲基]-4-[5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噻唑-3-基]萘-1-甲酰胺

[1401] (化合物实施例2-1;式IA化合物,其中R^{2a}、R^{2b}和R^{2c}是Cl,而A是A²=-C(=O)-NH-CH₂-(3,3-二氟环丁-1-基))

[1402] 在0℃向4-[5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噻唑-3-基]萘-1-羧酸(也即合成实施例1步骤6的产物)(0.2g),(3,3-二氟环丁基)甲基铵氯化物(70mg,CAS 1159813-93-0)和溴三吡咯烷基磷六氟磷酸盐("PyBroP",0.22g)的CH₂Cl₂(20mL)溶液加入N,N-二异丙基乙胺(0.2g)。在室温搅拌反应66小时。然后,浓缩混合物,残余物通过快速色谱法(乙酸乙酯/环己烷)在硅胶上纯化,提供产物(0.18g,75%)。

[1403] ¹H NMR(400MHz,CDCl₃):δ8.7(m,1H),8.2(m,1H),7.7-7.4(m,6H),6.0(m,1H),4.3(d,1H),4.1(d,1H),3.7(m,2H),2.9-2.7(m,2H),2.6-2.5(m,1H),2.5-2.3(m,2H)。

[1404] 合成实施例S.3

[1405] N-[[4-[5-[3-溴-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噻唑-3-基]-1-萘基]甲基]丙酰胺

[1406] (化合物实施例3-2;式IA化合物,其中R^{2a}是Br,R^{2b}是H,R^{2c}是CF₃,而A是A³=-CH₂-NH-C(=O)-CH₂CH₃)

[1407] 为了合成4-溴萘-1-腈(CAS 92616-49-4),参见WO 2007/087488(第24页)。

[1408] 步骤1:(4-溴-1-萘基)甲胺

[1409] 在0℃向4-溴萘-1-腈(60g)的THF(500mL)溶液滴加硼烷二甲基硫醚复合物溶液(780mL, 1M THF溶液, $\text{H}_3\text{B}-\text{S}(\text{CH}_3)_2$, CAS 13292-87-0)。在室温搅拌溶液过夜。然后, 在0℃, 加入甲醇(2L), 浓缩反应。加入饱和 NaHCO_3 水溶液, 水层用乙酸乙酯(3x 500mL)萃取。经合并的有机层用盐水洗涤, 干燥(Na_2SO_4), 过滤和浓缩, 提供粗制产物(42.5g, 70%), 其不加任何进一步纯化用于后续步骤。

[1410] 步骤2: N-[(4-溴-1-萘基)甲基]氨基甲酸叔丁酯

[1411] 在0℃向步骤1产物的THF(1L)溶液滴加三乙胺(150mL), 随后加入二碳酸二叔丁酯("Boc₂O", 92g)的THF(200mL)溶液。所得溶液在室温搅拌过夜。然后, 加水(800mL), 溶液用乙酸乙酯(3x 600mL)萃取。经合并的有机层用盐水洗涤, 干燥(Na_2SO_4), 过滤和浓缩。残余物通过快速色谱法(石油醚/乙酸乙酯)在硅胶上纯化, 提供产物(50g, 42%)。

[1412] ^1H NMR(400MHz, CDCl_3): δ 8.31(dd, 1H), 8.05(m, 1H), 7.74(d, 1H), 7.66-7.57(m, 2H), 7.29(d, 1H), 4.85(br. s, 1H), 4.75(m, 2H), 1.48(s, 9H)

[1413] 步骤3: N-[(4-乙酰基-1-萘基)甲基]氨基甲酸叔丁酯

[1414] 向步骤2产物(36g)的DMSO(600mL)溶液加入1-(乙烯基氧基)丁烷(40g), 三乙胺(8mL), 1,3-二(二苯基膦基)丙烷("DPPP", 2.4g)和 $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ (2.4g)。所得溶液在100℃搅拌过夜。将反应冷却至0℃, 用HCl水溶液(1M, 500mL)处理, 用乙酸乙酯(3x 500mL)萃取。经合并的有机层用盐水洗涤, 干燥(Na_2SO_4), 过滤, 浓缩。残余物通过快速色谱法(石油醚/乙酸乙酯)在硅胶上纯化, 提供产物(30g, 83%)。

[1415] ^1H NMR(400MHz, CDCl_3): δ 8.75(dd, 1H), 8.08(d, 1H), 7.88(d, 1H), 7.66-7.57(m, 2H), 7.49(d, 1H), 4.92(br. s, 1H), 4.82(m, 2H), 2.74(s, 3H), 1.49(s, 9H)。

[1416] 步骤4: N-[[4-[3-[3-溴-5-(三氟甲基)苯基]-4,4,4-三氟-丁-2-enoyl]-1-萘基]甲基]氨基甲酸叔丁酯

[1417] 向步骤3产物(32g)的乙酸乙酯(500mL)溶液加入1-[3-溴-5-(三氟甲基)苯基]-2,2,2-三氟-乙酮(CAS 1132701-00-8, 38.5g), K_2CO_3 (27.5g)和N,N-二异丙基乙胺(27.5g)。所得溶液在120℃搅拌过夜。然后, 将混合物冷却至室温, 用饱和 NH_4Cl 水溶液(400mL)处理, 用乙酸乙酯(3x 400mL)萃取。经合并的有机层用盐水洗涤, 干燥(Na_2SO_4), 过滤, 浓缩。残余物通过快速色谱法(石油醚/乙酸乙酯)在硅胶上纯化, 提供产物(31g, 48%)。

[1418] ^1H NMR(400MHz, CDCl_3): δ 8.46(d, 1H), 8.02(d, 1H), 7.71(d, 1H), 7.64-7.56(m, 2H), 7.49-7.40(m, 4H), 7.29(m, 1H), 4.88(br. s, 1H), 4.77(m, 2H), 1.49(s, 9H)。

[1419] 步骤5: N-[[4-[3-[3-溴-5-(三氟甲基)苯基]-4,4,4-三氟-3-硫烷基-丁酰基]-1-萘基]甲基]氨基甲酸叔丁酯

[1420] 将步骤4产物(15g, E/Z-异构体的混合物)的 CH_2Cl_2 (250mL)溶液用N,N-二异丙基乙胺(19.3g)处理。在-10℃, 将气态硫化氢(H_2S)鼓泡通过溶液直至溶液饱和。混合物在-10℃搅拌1小时, 用 CH_2Cl_2 稀释, 加至1M磷酸缓冲水溶液(pH 4-5)。分层。有机层用1M磷酸缓冲水溶液(pH 4-5)洗涤两次, 干燥(Na_2SO_4), 过滤, 浓缩, 提供粗制产物(14.3g, 90%), 其不加任何进一步纯化用于后续步骤。

[1421] ^1H NMR(400MHz, CDCl_3): δ 8.8-8.7(m, 1H), 8.1(m, 1H), 7.8(s, 1H), 7.7。(s, 1H), 7.7-7.4(m, 5H), 4.9(br. s, 1H), 4.8(m, 2H), 4.4(d, 1H), 4.1(d, 1H), 1.5(s, 9H)。

[1422] 步骤6: N-[[4-[5-[3-溴-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噻唑-3-基]-

1-萘基]甲基]氨基甲酸叔丁酯(化合物实施例3-1)

[1423] 在-10℃,将步骤5产物(14.3g)在CH₂Cl₂(250mL)中用N,N-二异丙基乙胺(11.7g)和用羟胺-O-磺酸("HOSA",3.1g)的水(10mL)溶液处理。在-10℃搅拌反应1.5小时,然后用CH₂Cl₂(300mL)稀释。有机层用饱和NH₄Cl水溶液(3x)洗涤。向有机层加入Na₂SO₄和对-甲苯磺酸("pTsOH",0.4g),所得悬浮液在室温搅拌2小时。然后,过滤反应,滤液用5%K₂CO₃水溶液(2x)洗涤,干燥(Na₂SO₄),过滤,浓缩,提供粗制产物,其通过快速色谱法在硅胶上纯化,提供产物(9.9g,69%)。

[1424] ¹H NMR(400MHz,CDCl₃):δ8.3(d,1H),8.1(m,2H),7.9-7.7(m,3H),7.7-7.5(m,3H),4.9(br.s,1H),4.8(m,2H),4.4(d,1H),4.1(d,1H),1.5(s,9H)。

[1425] 步骤7:[4-[5-[3-溴-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噻唑-3-基]-1-萘基]甲胺(化合物实施例3-2)

[1426] 将步骤6产物(6.7g)的CH₂Cl₂(100mL)溶液用1M的ZnCl₂的二乙醚(23mL)溶液处理,混合物在室温搅拌过夜。然后,加入额外的1M ZnCl₂的Et₂O(11mL)溶液,在35℃搅拌反应8h,在室温过夜。然后,加入二乙醚(400mL)。有机层用水洗涤(3x),干燥(Na₂SO₄),过滤,浓缩。残余物通过快速色谱法(CH₂Cl₂/甲醇)在硅胶上纯化,提供产物(2.06g,

[1427] 36%)。

[1428] ¹H NMR(400MHz,CDCl₃):δ8.0(m,2H),7.9-7.75(m,3H),7.65(s,1H),7.4-7.3(m,2H),6.9-6.8(m,1H),4.45(d,1H),4.3(br.s,2H),4.05(d,1H)。

[1429] 步骤8:N-[[4-[5-[3-溴-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噻唑-3-基]-1-萘基]甲基]丙酰胺

[1430] 在0℃向步骤7产物(0.2g)和三乙胺(80mg)的THF(20mL)溶液加入丙酰氯(40mg)。在室温搅拌反应66小时。然后,过滤混合物,用乙酸乙酯稀释。有机层用水洗涤(2x),干燥(Na₂SO₄),过滤,浓缩。残余物通过快速色谱法在硅胶上纯化,提供产物(0.12g,54%)。

[1431] ¹H NMR(400MHz,CDCl₃):δ8.7(d,1H),8.1(m,1H),7.8(s,1H),7.7(s,1H),7.7-7.5(m,4H),7.5(d,1H),5.7(br.s,1H),4.9(m,2H),4.3(d,1H),4.1(d,1H),2.2(q,2H),1.2(t,3H)。

[1432] II.评价农药活性:

[1433] 本发明式I化合物的活性能够通过下述生物学试验来展示和评价。

[1434] B.1小菜蛾(*Plutella xylostella*)

[1435] 将活性化合物以所希望的浓度溶解于1:1(vol:vol)蒸馏水:丙酮混合物中。表面活性剂(Kinetic HV)以0.01%(vol/vol)用量加入。试验溶液在使用当天制备。

[1436] 将卷心菜叶浸渍在试验溶液中,空气干燥。将经处理的叶子置于湿润滤纸衬底的培养皿,接种10只3rd龄幼虫。在处理72小时之后记录死亡率。也用0-100%的等级来记录摄食损害。

[1437] 在该测试中,化合物1-1,1-2,1-3,2-1,2-2,2-3和2-4于500ppm与未处理对照比较分别显示至少75%的死亡率。

[1438] B.2绿色桃蚜(*Myzus persicae*)

[1439] 为了评价通过内吸手段对绿色桃蚜(*Myzus persicae*)的防治,试验单元包括96-孔-微量滴定板,其中含有人工膜下的液体人工饵料。

[1440] 各化合物用含有75%v/v水和25%v/v DMSO的溶液配制。用定制的移液器将不同浓度的经配制化合物移取入蚜虫饵料中,重复两次。

[1441] 在施用之后,将5-8只成年蚜虫置于在微量滴定板各孔内的人工膜上。然后,让蚜虫吮吸经处理的蚜虫饵料,并在约 $23\pm 1^{\circ}\text{C}$ 和约 $50\pm 5\%$ 相对湿度温育3天。然后,对蚜虫死亡率和生殖力进行视觉评价。

[1442] 在该测试中,化合物1-1,1-3,2-1,2-2,2-3和2-4于2500ppm与未处理对照比较分别显示至少75%的死亡率。

[1443] B.3地中海实蝇(*Ceratitis capitata*)

[1444] 为了评价对地中海实蝇(*Ceratitis capitata*)的防治,试验单元包括微量滴定板,其中含有昆虫饵料和50-80个地中海实蝇的卵。

[1445] 各化合物用含有75%v/v水和25%v/v DMSO的溶液配制。用定制的微型雾化器将5 μl 不同浓度的经配制化合物喷雾至昆虫饵料上,重复两次。

[1446] 在施用之后,将微量滴定板在约 $28\pm 1^{\circ}\text{C}$ 和约 $80\pm 5\%$ 相对湿度温育5天。然后对卵和幼虫死亡率进行视觉评价。

[1447] 在该测试中,化合物1-1,1-2,1-3,2-1,2-2,2-3和2-4与未处理对照比较于2500ppm分别显示至少75%的死亡率。

[1448] B.4巢菜蚜虫(巢菜修尾蚜(*Megoura viciae*))

[1449] 为了通过接触或内吸手段评价对巢菜蚜虫(巢菜修尾蚜(*Megoura viciae*))的防治,试验单元包括24-孔-微量滴定板,其中含有蚕豆叶碟。

[1450] 各化合物用含有75%v/v水和25%v/v DMSO的溶液配制。用定制的微型雾化器将2.5 μl 不同浓度的经配制化合物喷雾于叶碟上,重复两次。

[1451] 在施用之后,将叶碟空气干燥,并将5-8只成年蚜虫置于在微量滴定板各孔内的叶碟上。然后,让蚜虫吮吸经处理的叶碟并在约 $23\pm 1^{\circ}\text{C}$ 和约 $50\pm 5\%$ 相对湿度温育5天。然后,对蚜虫死亡率和生殖力进行视觉评价。

[1452] 在该测试中,化合物1-3,2-1,2-2,2-3和2-4与未处理对照比较于2500ppm分别显示至少75%的死亡率。

[1453] B.5烟芽夜蛾(*Heliothis virescens*)

[1454] 为了评价对烟芽夜蛾(*Heliothis virescens*)的防治,试验单元包括96-孔-微量滴定板,其中含有昆虫饵料和15-25个烟芽夜蛾卵。

[1455] 各化合物用含有75%v/v水和25%v/v DMSO的溶液配制。用定制的微型雾化器将10 μl 不同浓度的经配制化合物喷雾至昆虫饵料上,重复两次。

[1456] 在施用之后,微量滴定板在约 $28\pm 1^{\circ}\text{C}$ 和约 $80\pm 5\%$ 相对湿度温育5天。然后对卵和幼虫死亡率进行视觉评价。

[1457] 在该测试中,化合物1-1,1-2,1-3,2-1,2-2,2-3和2-4与未处理对照比较于2500ppm分别显示至少75%的死亡率。

[1458] B.6棉铃象(*Anthonomus grandis*)

[1459] 为了评价对棉铃象(*Anthonomus grandis*)的防治,试验单元包括96-孔-微量滴定板,其中含有昆虫饵料和5-10个棉铃象卵。

[1460] 各化合物用含有75%v/v水和25%v/v DMSO的溶液配制。用定制的微型雾化器将5

μl不同浓度的经配制化合物喷雾至昆虫饵料上,重复两次。

[1461] 在施用之后,将微量滴定板在约 $25\pm 1^{\circ}\text{C}$ 和约 $75\pm 5\%$ 相对湿度温育5天。然后对卵和幼虫死亡率进行视觉评价。

[1462] 在该测试中,化合物1-1,1-2,1-3,2-1,2-2,2-3和2-4与未处理对照比较于2500ppm分别显示至少75%的死亡率。

[1463] B.7兰科蓟马(*dichromothrips corbetti*)

[1464] 用于生物测定的兰科蓟马(*Dichromothrips corbetti*)成虫得自连续保持在实验室条件下的群落。出于测试意图,试验化合物稀释于丙酮:水(vol:vol)的1:1混合物,以0.01%v/v用量添加Kinetic HV。

[1465] 用花浸没技术来评价各化合物的蓟马效力。将单独的完整兰科花卉的全部花瓣浸渍入处理溶液中,并在培养皿中干燥。将经处理的花瓣与约20只成年蓟马置于单独的可再密封的塑料容器中。全部试验台均保持在连续光照和约 28°C 的温度下,在测试时间期间持续。在3天之后,计数各花瓣上的活蓟马数。在处理72小时之后记录百分比死亡率。

[1466] 在该测试中,化合物2-1,2-2,2-3和2-4与未处理对照比较于500ppm分别显示至少75%的死亡率。