



(12)发明专利

(10)授权公告号 CN 107428732 B

(45)授权公告日 2020.09.08

(21)申请号 201680020375.1

(22)申请日 2016.02.05

(65)同一申请的已公布的文献号

申请公布号 CN 107428732 A

(43)申请公布日 2017.12.01

(30)优先权数据

15154252.9 2015.02.09 EP

(85)PCT国际申请进入国家阶段日

2017.09.30

(86)PCT国际申请的申请数据

PCT/EP2016/052445 2016.02.05

(87)PCT国际申请的公布数据

W02016/128298 DE 2016.08.18

(73)专利权人 拜耳作物科学股份公司

地址 德国莱茵河畔蒙海姆

(72)发明人 R·费舍尔 M·海尔 J-R·詹森

S·库贝勒 D·维尔基 A·科勒

(续)

(74)专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司

11285

代理人 王媛 钟守期

(51)Int.Cl.

C07D 401/14(2006.01)

(续)

(56)对比文件

US 5002961 A, 1991.03.26

W0 2011009804 A2, 2011.01.27

A. Joradaan等.the synthesis of 1-

methyl-5-5(alpha-indolyl)imidazole and 1-methyl-2-ethylthiol-5-(alpha-indolyl-9-imidazole).《J.heterocyclic Chem.》.1968,第5卷(第5期),第723-725页.

R. Bossio等.synthesis and properties of some S-derivatives of 1-benzyl- and 1-(2-pyridylmethyl)-5-substituted 2-mercaptoimidazoles.《heterocycles》.1986,第24卷(第4期),第983-989页.

D.E. Bierer等.regiospecific synthesis of the aminoimidazolquinoxaline mutagens from cooked foods.《J.Org.Chem.》.1992,第57卷(第5期),第1390-1405页.

M.P.HAY等.Design, synthesis, and evaluation of imidazolylmethyl carbamate prodrugs of alkylating agents.《tetrahedron》.2000,第56卷(第4期),第645-657页.

D. Norris等.synthesis of imidazo[1,5-a]quinoxalin-4(5H)-one template via a novel intramolecularp.《tetrahedron Letters》.2001,第42卷(第26期),第4297-4299页.

F. Hadizadeh等.synthesis of substituted 2-(2-alkylthio-1-benzyl-5-imidazolyl)-1,3,4-oxadiazoles.《J.heterocyclic Chem.》.2002,第39卷(第4期),第841-844页.

审查员 刘芳

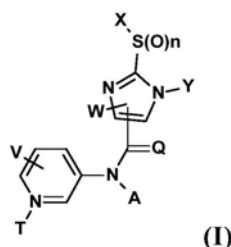
权利要求书8页 说明书149页

(54)发明名称

作为害虫防治剂的取代的2-硫代咪唑基羧酰胺

(57)摘要

本发明涉及通式(I)的化合物,其中Q、V、T、W、X、Y、n和A具有说明书中给出的含义;以及涉及其制备方法和其用于防治动物害虫的用途。



(I)

[接上页]

(72)发明人 M·维洛特 S·艾尔马斯

C07D 471/04(2006.01)

K·伊尔格 O·马萨姆

A01N 43/50(2006.01)

P·洛塞尔 D·波兹 W·安德施

A01N 43/54(2006.01)

(51)Int.Cl.

A01N 43/824(2006.01)

C07D 405/14(2006.01)

A01N 43/90(2006.01)

C07D 413/14(2006.01)

A01N 43/653(2006.01)

C07D 401/12(2006.01)

A01N 43/76(2006.01)

C07D 513/04(2006.01)

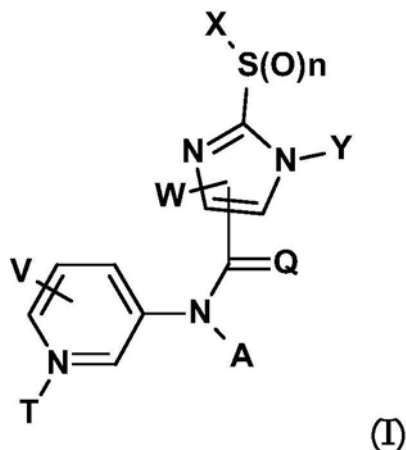
A01P 7/04(2006.01)

C07D 409/14(2006.01)

A01P 7/02(2006.01)

A01P 5/00(2006.01)

1. 式 (I) 的化合物或其盐



其中

Q代表氧,

V代表氢,

W代表选自以下的基团:氢和卤素,

X代表选自以下的基团: C_1-C_8 -烷基、 C_3-C_8 -烯基、 C_3-C_8 -炔基,其彼此独立地任选被卤素、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷基-S(O)_m、C(O)OR²、CONR²R³、C(G)R²单取代或多取代; C_3-C_8 -环烷基或 C_5-C_8 -环烯基,其彼此独立地任选被O、S(O)_m或NR⁴间隔一次或两次,且彼此独立地任选被 C_1-C_4 -烷基单取代至四取代;直链或支链 C_3-C_8 -环烷基- C_1-C_4 -烷基或 C_5-C_8 -环烯基- C_1-C_4 -烷基,其彼此独立地任选被O或NR⁴间隔一次或两次,且彼此独立地任选被 C_1-C_4 -烷基单取代至四取代;苯基,其彼此独立地任选被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基和硝基单取代至三取代;杂芳基,选自吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、三嗪基、呋喃基、噻吩基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、吡唑基、咪唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、苯并咪唑基、咪唑并吡啶基,并且其可彼此独立地任选被苯基、卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基和硝基单取代至三取代;直链或支链苯基- C_1-C_4 -烷基、杂芳基- C_1-C_4 -烷基,其中所述杂芳基选自选自吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、三嗪基、呋喃基、噻吩基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、吡唑基、咪唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、苯并咪唑基、咪唑并吡啶基,并且所述杂芳基- C_1-C_4 -烷基彼此独立地任选被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基和硝基单取代至三取代,

G代表O或N-OR²,

Y代表选自以下的基团:氢和 C_1-C_6 -烷基,

m代表数字0,

n代表数字0、1或2,

A代表选自以下的基团:氢和 C_1-C_6 -烷基,

R²代表选自以下的基团:氢; C_1-C_8 -烷基和 C_3-C_8 -环烷基,

R³代表选自以下的基团:氢和 C_1-C_6 -烷基,

R⁴代表选自以下的基团:氢和 C_1-C_6 -烷基,

T代表氧或电子对。

2. 权利要求1的化合物或其盐, 其中

Q代表氧,

Y代表选自以下的基团:氢、甲基和乙基,

W代表选自以下的基团:氢和氯,

X代表选自以下的基团: C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_6 -烯基、 C_3-C_6 -炔基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、C(O)OR²、CONR²R³、C(G)R²单取代至七取代; C_3-C_6 -环烷基,其彼此独立地任选被O、S(O)_m或NR⁴间隔一次或两次,且彼此独立地任选被甲基或乙基单取代或二取代;直链或支链 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_2 -烷基,其彼此独立地任选被O或NR⁴间隔一次或两次,且彼此独立地任选被甲基或乙基单取代或二取代;苯基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、4-叔丁基、甲氧基、乙氧基和硝基单取代或二取代;吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、三嗪基、呋喃基、噻吩基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、吡唑基、咪唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、苯并咪唑基、咪唑并吡啶基,上述基团彼此独立地任选被苯基、氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基和硝基单取代或二取代;直链或支链苯基- C_1-C_2 -烷基、吡啶基- C_1-C_2 -烷基、嘧啶基- C_1-C_2 -烷基、噻唑基- C_1-C_2 -烷基、吡唑基- C_1-C_2 -烷基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基和硝基单取代或二取代,

G代表O或N-OR²,

Y代表选自以下的基团:氢和 C_1-C_4 -烷基,

m代表数字0,

n代表数字0、1或2,

A代表选自以下的基团:氢和 C_1-C_6 -烷基,

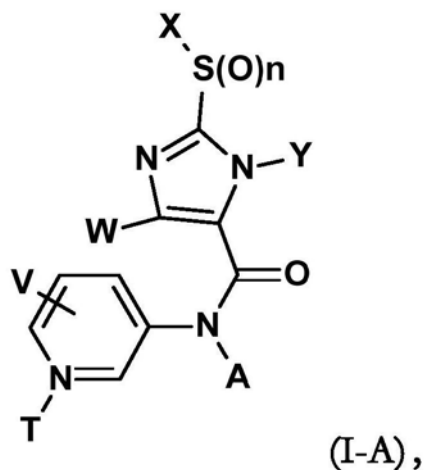
R²代表选自以下的基团:氢; C_1-C_6 -烷基和 C_3-C_6 -环烷基,

R³代表选自以下的基团:氢和 C_1-C_4 -烷基,

R⁴代表选自以下的基团:氢和 C_1-C_4 -烷基,

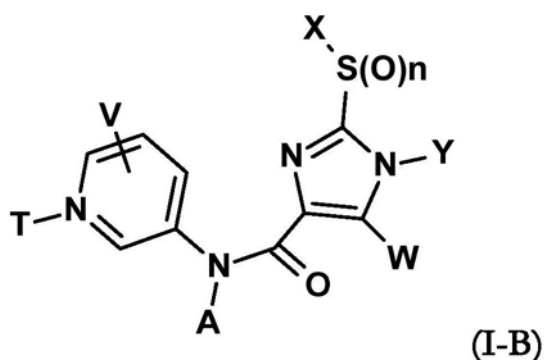
T代表氧或电子对。

3. 权利要求1化合物,结构式为



或其盐。

4. 权利要求1的化合物,结构式为



或其盐。

5. 权利要求3或4的化合物或其盐, 其中

V代表氢,

W代表选自以下的基团: 氢和氯,

X代表选自以下的基团: C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_4 -烯基、 C_3-C_4 -炔基, 其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-单取代、二取代、三取代、四取代、五取代, 且可任选地被基团C(O)OR²、CONR²R³、C(G)R²单取代; C_3-C_6 -环烷基, 其彼此独立地任选被O、S(O)_m或NR⁴间隔一次或两次, 且彼此独立地任选被甲基或乙基单取代或二取代; C_3-C_6 -环烷基甲基, 其彼此独立地任选被O或NR⁴间隔一次或两次, 且彼此独立地任选被甲基或乙基单取代或二取代; 苯基, 其彼此独立地任选被氟、氯、溴、4-叔丁基、甲氧基、乙氧基、二甲基氨基、二甲基氨基磺酰基、二甲基氨基氨基甲酰基和硝基单取代或二取代; 吡啶基、嘧啶基、噻吩基、噻唑基、噁唑基、咪唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、苯并咪唑基、咪唑并吡啶基, 上述基团彼此独立地任选被苯基、氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基和硝基单取代或二取代; 苄基、吡啶基甲基、嘧啶基甲基、噻唑基甲基、吡唑基- C_1-C_2 -烷基, 其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基和硝基单取代或二取代,

G代表O或N-OR²,

Y代表选自以下的基团: 氢和甲基,

m代表数字0,

n代表数字0、1或2,

A代表选自以下的基团: 氢、甲基、乙基和丙基,

R²代表选自以下的基团: 氢、 C_1-C_6 -烷基和 C_3-C_6 -环烷基,

R³代表选自以下的基团: 氢和 C_1-C_4 -烷基,

R⁴代表选自以下的基团: 氢和 C_1-C_4 -烷基,

T代表氧或电子对。

6. 权利要求3或4的化合物或其盐, 其中

V代表氢,

W代表选自以下的基团: 氢和氯,

X代表选自以下的基团: 甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、戊基、异戊基、2,2-二甲基丙基、己基、新己基、烯丙基、甲代烯丙基、2-丁烯基、炔丙基、2-丁炔基, 其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺

酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基单取代至三取代,且可任选地被基团C(O)OR²、CONR²R³、C(G)R²单取代;环丙基、环丁基、环戊基、环己基,其彼此独立地任选被O、S(O)_m或NR⁴间隔一次或两次,且彼此独立地任选被甲基或乙基单取代或二取代;环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基、环己基甲基,其彼此独立地任选被O或NR⁴间隔一次或两次,且彼此独立地任选被甲基或乙基单取代或二取代;苯基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、4-叔丁基、甲氧基、乙氧基、二甲基氨基、二甲基氨基磺酰基、二甲基氨基氨基甲酰基和硝基单取代或二取代;吡啶基、嘧啶基、噻吩基、噻唑基、噁唑基、咪唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、苯并咪唑基、咪唑并吡啶基,上述基团彼此独立地任选被苯基、氟、氯、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基和硝基单取代或二取代;苄基、吡啶基甲基、嘧啶基甲基、噻唑基甲基、吡唑基-C₁-C₂-烷基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基和硝基单取代或二取代,

G代表O或N-OR²,

Y代表选自以下的基团:氢、甲基、乙基和丙基,

m代表数字0,

n代表数字0、1或2,

A代表选自以下的基团:氢和甲基,

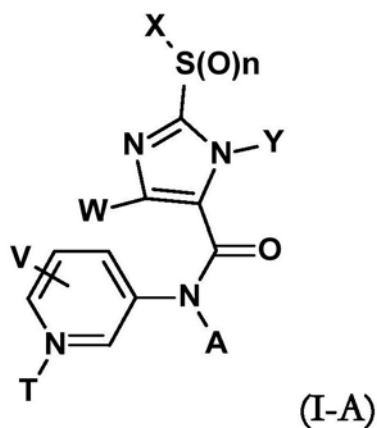
R²代表选自以下的基团:氢、甲基、乙基、丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、环丙基、环丁基、环戊基和环己基,

R³代表选自以下的基团:氢、甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基和异丁基,

R⁴代表选自以下的基团:氢、甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基和异丁基,

T代表氧或电子对。

7. 权利要求3的式(I-A)的化合物或其盐,其中



V代表氢,

W代表选自以下的基团:氢和氯,

X代表选自以下的基团:甲基、乙基、正丁基、正戊基、正丙基、异丙基、烯丙基、3,3-二甲基烯丙基、炔丙基、环己基、四氢吡喃基、四氢噻喃基、3-氧杂环丁基、5-氧杂-[3.3.0]-双环庚基、甲氧基乙基、甲氧基丙基、乙氧基乙基、乙硫基乙基、甲硫基乙基、二氟甲基、三氟甲基、2,2,2-三氟乙基、3,3,3-三氟丙基、3-氯-2,2,3,3-四氟丙基、3-氟丙基、3,3-二氟丙基、2,2,2-三氟乙硫基乙基、甲基羰基甲基、环丙基羰基甲基、叔丁基羰基甲基、甲氧基羰基甲基、乙氧基羰基甲基、羟基羰基甲基、氨基甲酰基甲基、N-甲基氨基甲酰基甲基、N-环丙基氨基

基甲酰基甲基、N,N-二甲基氨基甲酰基甲基、2-甲氧基亚氨基丙基、环丙基甲基、苯基、4-甲基苯基、2-硝基苯基、3-甲硫基苯基、4-氯苯基、4-氟苯基、4-叔丁基苯基、4-甲氧基苯基、4-硝基苯基、2-氟苯基、2-甲氧基苯基、3-硝基苯基、3-三氟甲基苯基、3-氯苯基、2,5-二氯苯基、3,5-二氯苯基、4-氯-3-三氟甲基苯基、2,4,5-三氯苯基、2-吡啶基、5-(2-氯)吡啶基、2-(5-甲基)吡啶基、2-(6-甲基)吡啶基、2-(3-三氟甲基)吡啶基、2-嘧啶基、2-(4-甲基)嘧啶基、2-(5-甲基)嘧啶基、2-(4-甲氧基)嘧啶基、2-(5-氟)嘧啶基、2-(4-三氟甲基)嘧啶基、2-(5-三氟甲基)嘧啶基、2-(4,6-二甲基)嘧啶基、2-(4,5-二甲基)嘧啶基、2-(4,6-二甲氧基)嘧啶基、-CH₂-2-嘧啶基、-CH₂-2-吡嗪基、-CH₂-5-(1-甲基)咪唑基、-CH₂-3-(1-甲基)吡唑基、-CH₂-4-吡啶基、-CH₂-2-吡啶基、-CH₂-2-(1-甲基)咪唑基、-CH₂-3-吡啶基、-CH₂-2-呋喃基、-CH₂-5-(2-氯)吡啶基、苄基、3,4-二氯苄基、2,6-二氟苄基、2-氟-6-甲氧基苄基、2,6-二氯苄基、2-氯-6-三氟甲基苄基、2-氯-6-氟苄基、-CH₂-2-(4,6-二甲氧基)嘧啶基、2,6-二甲基苄基、-CH₂-1-(3-硝基-5-甲基)吡唑基、2-(1-甲基)苯并咪唑基、2-(5-甲基)噁二唑基、2-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4.5]吡啶基、3-[4-乙基-5-(三氟甲基)]-1,2,4-三唑基、3-[4-甲基-5-(三氟甲基)]-1,2,4-三唑基、3-[4-甲基-5-(二氟甲基)]-1,2,4-三唑基、2-(5-苯基)-1,3,4-噁二唑基、2-(1-甲基-5-苯基)咪唑基、2-(4,5-二甲基)噁唑基、2-(1-甲基-5-甲氧基羰基)咪唑基、2-(1-甲基)咪唑基、1,2-乙烷二基，

Y代表甲基或乙基，

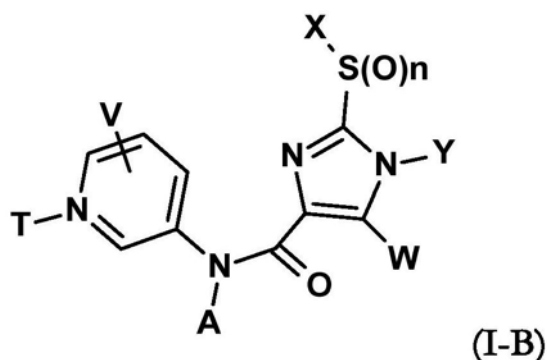
n代表数字0或2，

A代表选自氢和甲基的基团，

T代表电子对

或

权利要求4的式 (I-B) 的化合物或其盐



其中

V代表氢，

W代表选自以下的基团：氢和氯，

X代表选自以下的基团：4,6-二甲基嘧啶基、正丁基、正戊基、苄基、甲基、3-甲硫基苯基、2,2,2-三氟乙基、苯基、4-甲基苯基、嘧啶基、乙硫基乙基、2-硝基苯基和环丙基甲基，

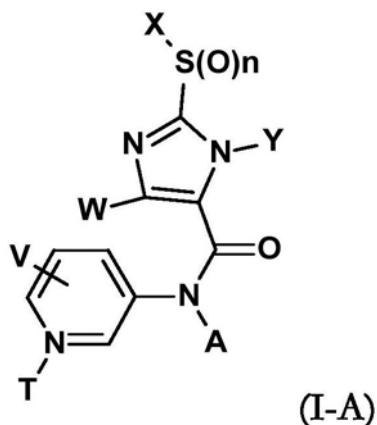
Y代表甲基，

n代表数字0或2，

A代表选自氢和甲基的基团，

T代表电子对。

8. 式 (I-A) 的化合物或其盐, 其中



V代表氢,

W代表选自以下的基团: 氢和氯,

X代表选自以下的基团: 4-二甲基氨基苯基、2-二甲基氨基磺酰基苯基、2-二甲基氨基氨基甲酰基苯基,

Y代表甲基或乙基,

n代表数字0或2,

A代表选自氢和甲基的基团,

T代表电子对。

9. 组合物, 其包含至少一种权利要求1至8中任一项的化合物或其盐, 以及常规的增量剂和/或表面活性剂, 所述组合物用于防治动物害虫。

10. 防治动物害虫的方法, 其中使至少一种权利要求1至8中任一项的化合物或其盐或权利要求9的组合物作用于动物害虫和/或其生境, 其中不包括对人体和动物体的手术、治疗性和诊断性治疗。

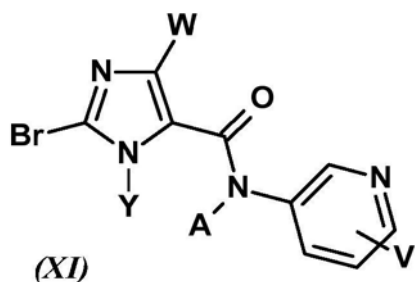
11. 至少一种权利要求1至8中任一项的化合物或其盐或权利要求9的组合物用于防治动物害虫的用途, 其中不包括对人体和动物体的手术、治疗性和诊断性治疗。

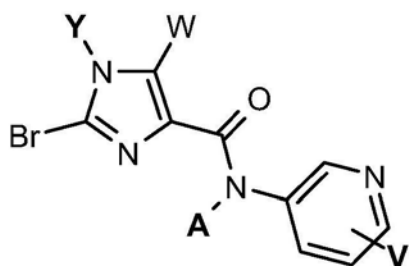
12. 至少一种权利要求1至8中任一项的化合物用于保护植物繁殖材料的用途。

13. 农用化学制剂, 其包含基于农用化学制剂的重量计0.00000001至98重量%的生物有效量的至少一种权利要求1至8中任一项的化合物或其盐, 以及增量剂和/或表面活性剂。

14. 权利要求13的农用化学制剂, 其还包含其他农用化学活性化合物。

15. 式 (XI) 或 (XXI) 的中间体,





(XXI),

其中

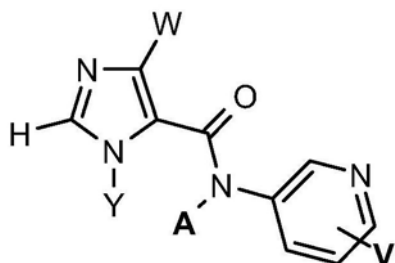
V代表氢，

W代表选自以下的基团：氢和卤素，

Y代表选自以下的基团：氢和C₁-C₆烷基，并且

A代表选自以下的基团：氢和C₁-C₆烷基。

16. 式 (XV) 的中间体



(XV),

其中

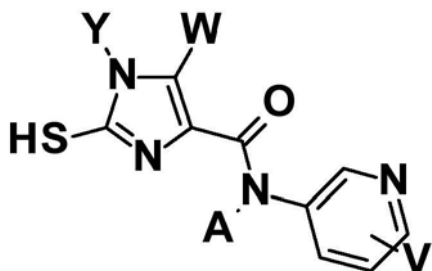
V代表氢，

W代表选自以下的基团：氢和氯，

Y代表甲基或乙基，并且

A代表选自以下的基团：氢和甲基。

17. 式 (XXII) 的中间体



(XXII),

其中

V代表氢，

W代表选自以下的基团：氢和氯，

Y代表甲基,并且

A代表选自以下的基团:氢和甲基。

作为害虫防治剂的取代的2-硫代咪唑基羧酰胺

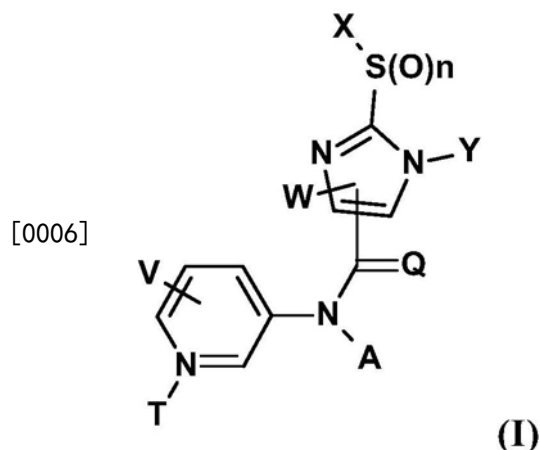
[0001] 本发明涉及新的杂环化合物,用于制备它的方法和中间体,以及其用于防治动物害虫的用途。

[0002] WO 2011/009804 A2记载了尤其包括可用作杀虫剂的咪唑基羧酰胺的杂环化合物。

[0003] 现代杀虫剂必须满足许多要求,例如关于它们的作用程度、作用持久性和作用谱以及可能的用途。毒性、有益物种和传粉者的保护、环境特性、施用率、与其他活性成分或制剂助剂的结合性的问题起作用,用于合成活性成分所需的努力的问题亦是如此;此外,就仅提及的一些参数而言,可能产生抗性。仅出于所有这些原因,也不能认为对新的作物保护组合物的研究已经完成,而是不断需要与已知化合物相比至少在个别方面具有改进特性的新的化合物。

[0004] 本发明的目的是提供在多个方面拓宽农药谱的化合物。

[0005] 该目的以及没有明确说明但可从本文所讨论的内容推出或得出的其他目的均是通过提供式(I)的化合物及其盐来实现的



[0007] 其中

[0008] Q代表氧或硫,

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

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

[0011] X代表选自以下的基团:任选取代的烷基、烯基、炔基;任选取代的环烷基,其为饱和或不饱和的且任选地被杂原子间隔;任选取代的环烷基烷基,其为饱和或不饱和的且任选地被杂原子间隔;任选取代的芳基、杂芳基;任选取代的芳基烷基、杂芳基烷基;以及氰基,

[0012] Y代表选自以下的基团:氢;任选取代的烷基、烯基、炔基;任选取代的环烷基,其任选地被杂原子间隔;任选取代的环烷基烷基,其任选地被杂原子间隔;芳基烷基;杂芳基烷基;以及氰基,

[0013] n代表数字0、1或2,

[0014] A代表选自以下的基团:氢;任选取代的烷基、烯基、炔基;以及任选取代的环烷基和环烷基烷基,其任选地被杂原子间隔,

[0015] T代表氧或电子对。

[0016] 在式(I)的化合物及其盐中,所示基团的优选的取代基或范围如下所示。其组合形成优选范围(1)。

[0017] Q代表氧或硫,

[0018] V代表选自以下的基团:氢、卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基和氰基,

[0019] W代表选自以下的基团:氢、卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基和氰基,

[0020] X代表选自以下的基团:C₁-C₈-烷基、C₃-C₈-烯基、C₃-C₈-炔基,其彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_m-、氰基、C(O)OR²、CONR²R³、C(G)R²单取代或多取代;C₃-C₈-环烷基或C₅-C₈-环烯基,其彼此独立地任选被O、S(O)_m、C(G)R²、NR⁴间隔一次或两次,且彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、氰基单取代至四取代;直链或支链C₃-C₈-环烷基-C₁-C₄-烷基或C₅-C₈-环烯基-C₁-C₄-烷基,其彼此独立地任选被O、S(O)_m、C(G)R²、NR⁴间隔一次或两次,且彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、氰基单取代至四取代;芳基,其彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_m-、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代至三取代;或杂芳基,其可彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_m-、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代至三取代;直链或支链芳基-C₁-C₄-烷基、杂芳基-C₁-C₄-烷基,其彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_m-、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代至三取代,

[0021] G代表O、N-CN、N-OR²,

[0022] Y代表选自以下的基团:氢;C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-烯基、C₃-C₆-炔基,其彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_m-、氰基单取代或多取代;C₃-C₈-环烷基,其彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、氰基单取代或二取代;直链或支链C₃-C₈-环烷基-C₁-C₄-烷基,其彼此独立地任选被O、S(O)_m、CO、NR⁴间隔一次或两次,且彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、氰基单取代至四取代;芳基烷基或杂芳基烷基,其彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_m-、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代至三取代;以及氰基,

[0023] m代表数字0、1或2,

[0024] n代表数字0、1或2,

[0025] A代表选自以下的基团:氢;C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-烯基、C₃-C₆-炔基,其彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_m-、氰基单取代或多取代;C₃-C₆-环烷基,其彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、氰基单取代或二取代;以及直链或支链C₃-C₈-环烷基-C₁-C₄-烷基,其彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、氰基单取代或二取代,

[0026] R²代表选自以下的基团:氢;C₁-C₈-烷基、C₃-C₈-烯基、C₃-C₈-炔基,其彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_m-单取代或多取代;C₃-C₈-环烷基,其任选地被O、

S(O)_m间隔一次,且彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、氰基单取代或二取代;直链或支链C₃-C₈-环烷基-C₁-C₄-烷基,其任选地被O、S(O)_n间隔一次,且彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、氰基单取代或二取代;芳基、杂芳基,其彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_m-、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代至三取代;以及直链或支链芳基-C₁-C₄-烷基、杂芳基-C₁-C₄-烷基,其彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_m-、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代至三取代,

[0027] R³代表选自以下的基团:氢;C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-烯基、C₃-C₆-炔基,其彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_m-、氰基单取代或多取代,

[0028] R⁴代表选自以下的基团:氢;C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-烯基、C₃-C₆-炔基,其彼此独立地任选被卤素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_m-、氰基单取代或多取代;以及代表基团CONR²R³和COR²,其中以上优选范围(1)的定义适用于R²和R³,

[0029] T代表氧或电子对。

[0030] 在式(I)的化合物及其盐中,所示基团的特别优选的取代基或范围如下所示。其组合形成优选范围(2)。

[0031] Q代表氧,

[0032] Y代表选自以下的基团:氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基和氰基,

[0033] W代表选自以下的基团:氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基和氰基,

[0034] X代表选自以下的基团:C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-烯基、C₃-C₆-炔基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、氰基、C(O)OR²、CONR²R³、C(G)R²单取代至七取代;C₃-C₆-环烷基,其彼此独立地任选被O、S(O)_m、CO、NR⁴间隔一次或两次,且任选彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、氰基单取代或二取代;直链或支链C₃-C₆-环烷基-C₁-C₂-烷基,其彼此独立地任选被O、S(O)_m、CO、NR⁴间隔一次或两次,且彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、氰基单取代或二取代;苯基、萘基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、三嗪基、呋喃基、噻吩基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、吡唑基、咪唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、苯并咪唑基、咪唑并吡啶基,上述取代基可任选地被苯基取代,所述苯基彼此独立地被氟、氯、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_n-、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基-S(O)_m-、二氟乙基-S(O)_m-、三氟甲基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代至三取代,且上述取代基彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_n-、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基-S(O)_m-、二氟乙基-S(O)_m-、三氟乙基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代或二取代;直链或支链苯基-C₁-C₂-烷基、吡啶基-C₁-C₂-烷基、嘧啶基-C₁-C₂-烷基、噻唑基-C₁-C₂-烷基、吡唑基-C₁-C₂-烷基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、Me-S(O)_m-、Et-S(O)_m-、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基-S(O)_m-、二氟乙基-S(O)_m-、三氟乙基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代或二取代;以及氰基,

[0035] G代表O、N-OR²,

[0036] Y代表选自以下的基团:氢;C₁-C₄-烷基、C₃-C₄-烯基、C₃-C₄-炔基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、氰基单取代至五取代;C₃-C₆-环烷基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、氰基单取代或二取代;直链或支链C₃-C₆-环烷基-C₁-C₂-烷基,其彼此独立地任选被O、S(O)_m、CO、NR⁴间隔一次或两次,且彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、氰基单取代至四取代;芳基-C₁-C₂-烷基或杂芳基-C₁-C₂-烷基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、C₁-C₄-卤代烷基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、氰基、硝基单取代或二取代;以及氰基,

[0037] m代表数字0、1或2,

[0038] n代表数字0、1或2,

[0039] A代表选自以下的基团:氢;C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-烯基、C₃-C₆-炔基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、氰基单取代至五取代;C₃-C₆-环烷基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、氰基单取代或二取代;直链或支链C₃-C₆-环烷基-C₁-C₂-烷基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、氰基单取代或二取代,

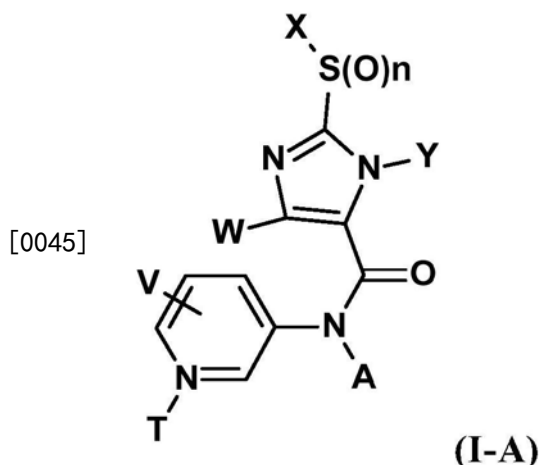
[0040] R²代表选自以下的基团:氢;C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-烯基、C₃-C₆-炔基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-单取代至五取代;C₃-C₆-环烷基,其任选地被O、S(O)_m间隔一次且彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、氰基单取代或二取代;直链或支链C₃-C₆-环烷基-C₁-C₂-烷基,其任选地被O、S(O)_m间隔一次且彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、氰基单取代或二取代;苯基或吡啶基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基-S(O)_m-、二氟乙基-S(O)_m-、三氟乙基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代或二取代;以及直链或支链苯基-C₁-C₂-烷基、吡啶基-C₁-C₂-烷基、嘧啶基-C₁-C₂-烷基、噻唑基-C₁-C₂-烷基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基-S(O)_n-、二氟乙基-S(O)_n-、三氟乙基-S(O)_n-、硝基和氰基单取代或二取代,

[0041] R³代表选自以下的基团:氢;C₁-C₄-烷基、C₃-C₄-烯基、C₃-C₄-炔基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、氰基单取代至五取代,

[0042] R⁴代表选自以下的基团:氢;C₁-C₄-烷基、C₃-C₄-烯基、C₃-C₄-炔基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、氰基单取代至五取代;以及代表基团CONR²R³和COR²,其中以上优选范围(2)的定义适用于R²和R³,

[0043] T代表氧或电子对。

[0044] 在式(I)的化合物及其盐中,所示基团的非常特别优选的取代基或范围如下所示。考虑到咪唑基上的羧酰胺基团的位置,得到非常特别优选的结构(I-A)。其组合形成优选范围(3-A)。



[0046] V代表选自以下的基团:氢、氟、氯、甲基和氰基,

[0047] W代表选自以下的基团:氢、氟、氯、溴、甲基、乙基和氰基,

[0048] X代表选自以下的基团: C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_4 -烯基、 C_3-C_4 -炔基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、氰基单取代、二取代、三取代、四取代、五取代,且可任选地被基团C(O)OR²、CONR²R³、C(G)R²单取代; C_3-C_6 -环烷基,其彼此独立地任选被O、S(O)_m、CO、NR⁴间隔一次或两次,且彼此独立地任选被氟、氯、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、氰基单取代或二取代; C_3-C_6 -环烷基甲基,其彼此独立地任选被O、S(O)_m、CO、NR⁴间隔一次或两次,且彼此独立地任选被氟、氯、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、氰基单取代或二取代;苯基、吡啶基、嘧啶基、噻吩基、噻唑基、噁唑基、咪唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、苯并咪唑基、咪唑并吡啶基,上述取代基可任选地被苯基取代,所述苯基彼此独立地被氟、氯、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_n-、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基-S(O)_m-、二氟乙基-S(O)_m-、三氟乙基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代或二取代,且上述取代基彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基-S(O)_m-、二氟乙基-S(O)_m-、三氟乙基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代或二取代;苄基、吡啶基甲基、嘧啶基甲基、噻唑基甲基、吡唑基- C_1-C_2 -烷基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、Me-S(O)_m-、Et-S(O)_m-、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基-S(O)_n-、二氟乙基-S(O)_m-、三氟乙基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代或二取代;以及氰基,

[0049] G代表O、N-OR²,

[0050] Y代表选自以下的基团:氢;甲基、乙基、丙基、烯丙基、炔丙基和苄基,其彼此独立地任选被氟、甲氧基、乙氧基、氰基单取代至三取代,

[0051] m代表数字0、1或2,

[0052] n代表数字0、1或2,

[0053] A代表选自以下的基团:氢;甲基、乙基、丙基、烯丙基、炔丙基、环丙基或环丙基甲基,其彼此独立地任选被氟、甲氧基、乙氧基、氰基单取代至三取代,

[0054] R²代表选自以下的基团:氢; C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_6 -烯基、 C_3-C_6 -炔基,其彼此独立地任选被氟、氯、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-单取代至三取代; C_3-C_6 -环烷基,其任选地被O、S(O)_m间隔一次,且彼此独立地任选被氟、氯、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、氰基单取代或二取代; C_3-C_6 -环烷基甲基,其任选地被O、S(O)_m间隔一次,且彼此独立地任选被

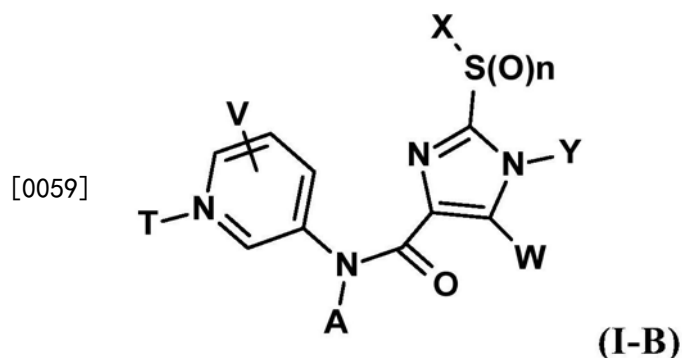
氟、氯、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、氰基单取代或二取代；苯基或吡啶基，其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基-S(O)_m-、二氟乙基-S(O)_m-、三氟乙基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代或二取代；以及苄基、吡啶基甲基、嘧啶基甲基、噻唑基甲基，其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基-S(O)_m-、二氟乙基-S(O)_m-、三氟乙基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代或二取代，

[0055] R³代表选自以下的基团：氢；C₁-C₄-烷基、C₃-C₄-烯基、C₃-C₄-炔基，其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、氰基单取代至三取代，

[0056] R⁴代表选自以下的基团：氢；C₁-C₄-烷基、C₃-C₄-烯基、C₃-C₄-炔基，其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、氰基单取代至三取代；以及代表基团CONR²R³和COR²，其中以上优选范围(3A)的定义适用于R²和R³，

[0057] T代表氧或电子对。

[0058] 在式(I)的化合物及其盐中，所示基团的非常特别优选的取代基或范围如下所示。考虑到咪唑基上的羧酰胺基团的位置，得到非常特别优选的结构(I-B)。其组合形成优选范围(3-B)。



[0060] V代表选自以下的基团：氢、氟、氯、甲基和氰基，

[0061] W代表选自以下的基团：氢、氟、氯、溴、甲基、乙基和氰基，

[0062] X代表选自以下的基团：C₁-C₆-烷基、C₃-C₄-烯基、C₃-C₄-炔基，其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、氰基单取代至五取代，且可任选被基团C(O)OR²、CONR²R³、C(G)R²单取代；C₃-C₆-环烷基，其彼此独立地任选被O、S(O)_m、CO、NR⁴间隔一次或两次，且彼此独立地任选被氟、氯、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、氰基单取代或二取代；C₃-C₆-环烷基甲基，其彼此独立地任选被O、S(O)_m、CO、NR⁴间隔一次或两次，且彼此独立地任选被氟、氯、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、氰基单取代或二取代；苯基、吡啶基、嘧啶基、噻吩基、噻唑基、噁唑基、咪唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、苯并咪唑基、咪唑并吡啶基，上述取代基可任选地被苯基取代，所述苯基彼此独立地被氟、氯、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_n-、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基-S(O)_m-、二氟乙基-S(O)_m-、三氟乙基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代或二取代，且上述取代基彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基-S(O)_m-、二氟乙基-S(O)_m-、三氟乙基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代或二取代；苄基、吡啶基甲基、嘧啶基甲基、噻唑基甲基、吡唑基-

C₁-C₂-烷基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、Me-S(O)_m-、Et-S(O)_m-、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基-S(O)_m-、二氟乙基-S(O)_m-、三氟乙基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代或二取代;以及氰基,

[0063] G代表O、N-OR²,

[0064] Y代表选自以下的基团:氢;甲基、乙基、丙基、烯丙基、炔丙基和苄基,其彼此独立地任选被氟、甲氧基、乙氧基、氰基单取代至三取代,

[0065] m代表数字0、1或2,

[0066] n代表数字0、1或2,

[0067] A代表选自以下的基团:氢;甲基、乙基、丙基、烯丙基、炔丙基、环丙基或环丙基甲基,其彼此独立地任选被氟、甲氧基、乙氧基、氰基单取代至三取代,

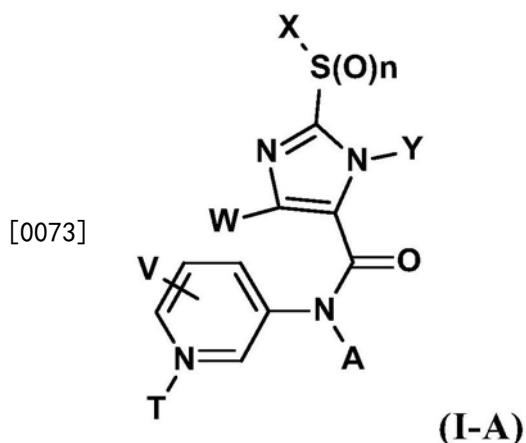
[0068] R²代表选自以下的基团:氢;C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-烯基、C₃-C₆-炔基,其彼此独立地任选被氟、氯、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-单取代至三取代;C₃-C₆-环烷基,其任选地被O、S(O)_m间隔一次,且彼此独立地任选被氟、氯、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、氰基单取代或二取代;C₃-C₆-环烷基甲基,其任选地被O、S(O)_m间隔一次,且彼此独立地任选被氟、氯、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、氰基单取代或二取代;苄基或吡啶基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基-S(O)_m-、二氟乙基-S(O)_m-、三氟乙基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代或二取代;以及苄基、吡啶基甲基、嘧啶基甲基、噻唑基甲基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基-S(O)_m-、二氟乙基-S(O)_m-、三氟乙基-S(O)_m-、硝基和氰基单取代或二取代,

[0069] R³代表选自以下的基团:氢;C₁-C₄-烷基、C₃-C₄-烯基、C₃-C₄-炔基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、氰基单取代至三取代,

[0070] R⁴代表选自以下的基团:氢;C₁-C₄-烷基、C₃-C₄-烯基、C₃-C₄-炔基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、甲基-S(O)_m-、乙基-S(O)_m-、氰基单取代至三取代;以及代表基团CONR²R³和COR²,其中以上优选范围(3B)的定义适用于R²和R³,

[0071] T代表氧或电子对。

[0072] 在式(I)的化合物及其盐中,所示基团的尤其优选的取代基或范围如下所示。考虑到咪唑基上的羧酰胺基团的位置,得到尤其优选的结构(I-A)。其与尤其优选的取代基的组合形成优选范围(4-A)。



[0074] V代表氢或氟，

[0075] W代表选自以下的基团：氢、氯、溴和甲基，

[0076] X代表选自以下的基团：甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、戊基、异戊基、2,2-二甲基丙基、己基、新己基、烯丙基、甲代烯丙基、2-丁烯基、炔丙基、2-丁炔基，其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、甲硫基(methylsulphanyl)、乙硫基(ethylsulphanyl)、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基单取代至三取代，且可任选地被基团C(O)OR²、CONR²R³、C(G)R²单取代；环丙基、环丁基、环戊基、环己基，其彼此独立地任选被O、S(O)_m、CO、NR⁴间隔一次或两次，且彼此独立地任选被氟、氯、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、氰基单取代或二取代；环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基、环己基甲基，其彼此独立地任选被O、S(O)_m、CO、NR⁴间隔一次或两次，且彼此独立地任选被氟、氯、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、氰基单取代或二取代；苯基、吡啶基、嘧啶基、噻吩基、噻唑基、噁唑基、咪唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、苯并咪唑基、咪唑并吡啶基，上述取代基可任选地被苯基取代，且彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲硫基、三氟甲基亚磺酰基、三氟甲基磺酰基、二氟甲硫基、二氟甲基亚磺酰基、二氟甲基磺酰基、三氟乙硫基、三氟乙基亚磺酰基、三氟乙基磺酰基、硝基和氰基单取代或二取代；苄基、吡啶基甲基、嘧啶基甲基、噻唑基甲基、吡唑基-C₁-C₂-烷基，其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲硫基、三氟甲基亚磺酰基、三氟甲基磺酰基、二氟甲硫基、二氟甲基亚磺酰基、二氟甲基磺酰基、三氟乙硫基、三氟乙基亚磺酰基、三氟乙基磺酰基、硝基和氰基单取代或二取代；以及氰基，

[0077] G代表O、N-OR²，

[0078] Y代表选自以下的基团：氢、甲基、乙基、丙基、二氟乙基、三氟乙基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、氰基甲基和苄基，

[0079] m代表数字0、1或2，

[0080] n代表数字0、1或2，

[0081] A代表选自以下的基团：氢、甲基、乙基、丙基、二氟乙基、三氟乙基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、氰基甲基、烯丙基、炔丙基、环丙基或环丙基甲基，

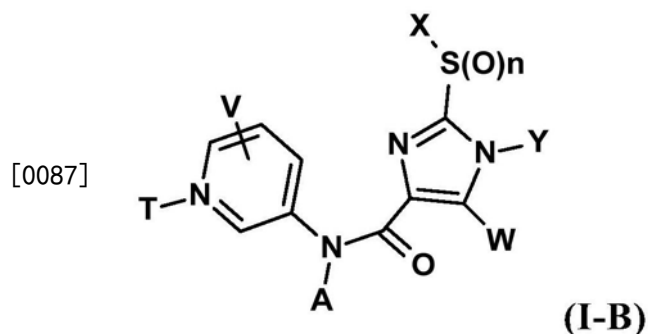
[0082] R^2 代表选自以下的基团:氢;甲基、乙基、丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、烯丙基、甲代烯丙基、2-丁烯基、炔丙基、2-丁炔基,其彼此独立地任选被氟、氯、甲氧基、乙氧基单取代至三取代;环丙基、环丁基、环戊基、环己基,其任选地被O、S(O)_m间隔一次,且彼此独立地任选被氟、氯、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、氰基单取代或二取代;环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基、环己基甲基,其任选地被O、S(O)_m间隔一次,且彼此独立地任选被氟、氯、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、氰基单取代或二取代;苯基或吡啶基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲硫基、三氟甲基亚磺酰基、三氟甲基磺酰基、二氟甲硫基、二氟甲基亚磺酰基、二氟甲基磺酰基、三氟乙硫基、三氟乙基亚磺酰基、三氟乙基磺酰基、硝基和氰基单取代或二取代;以及苄基、吡啶基甲基、嘧啶基甲基、噻唑基甲基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、硝基和氰基单取代或二取代,

[0083] R^3 代表选自以下的基团:氢、甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基和烯丙基,

[0084] R^4 代表选自以下的基团:氢;彼此独立地任选被氟、甲氧基、乙氧基、氰基甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基和烯丙基取代一至三次;以及代表基团CONR²R³和COR²,其中以上优选范围(4A)的定义适用于R²和R³,

[0085] T代表氧或电子对。

[0086] 在式(I)的化合物及其盐中,所示基团的尤其优选的取代基或范围如下所示。考虑到咪唑基上的羧酰胺基团的位置,得到尤其优选的结构(I-B)。其与尤其优选的取代基的组合形成优选范围(4-B)。



[0088] V代表氢或氟,

[0089] W代表选自以下的基团:氢、氯、溴和甲基,

[0090] X代表选自以下的基团:甲基、乙基、丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、戊基、异戊基、2,2-二甲基丙基、己基、新己基、烯丙基、甲代烯丙基、2-丁烯基、炔丙基、2-丁炔基,其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、氰基单取代至三取代,且可任选地被基团C(O)OR²、CONR²R³、C(G)R²单取代;环丙基、环丁基、环戊基、环己基,其彼此独立地任选被O、S(O)_m、CO、NR⁴间隔一次或两次,且彼此独立地任选被氟、氯、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、氰基单取代或二取代;环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基、环己基甲基,其彼此独立地任选被O、S(O)_m、CO、NR⁴间隔一次或两次,且彼此独立地任选被氟、氯、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、氰基单取代或二取代;苯基、吡啶基、嘧啶基、噻吩基、噻唑基、噁唑基、咪唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、苯并咪唑基、咪唑并吡啶基,其可任选地被苯基取代,且可彼此独立地任选

被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲硫基、三氟甲基亚磺酰基、三氟甲基磺酰基、二氟甲硫基、二氟甲基亚磺酰基、二氟甲基磺酰基、三氟乙硫基、三氟乙基亚磺酰基、三氟乙基磺酰基、硝基和氰基单取代或二取代；苄基、吡啶基甲基、嘧啶基甲基、噻唑基甲基、吡唑基-C₁-C₂-烷基，其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲硫基、三氟甲基亚磺酰基、三氟甲基磺酰基、二氟甲硫基、二氟甲基亚磺酰基、二氟甲基磺酰基、三氟乙硫基、三氟乙基亚磺酰基、三氟乙基磺酰基、硝基和氰基单取代或二取代；以及氰基，

[0091] G代表O、N-OR²，

[0092] Y代表选自以下的基团：氢、甲基、乙基、丙基、二氟乙基、三氟乙基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、氰基甲基和苄基，

[0093] m代表数字0、1或2，

[0094] n代表数字0、1或2，

[0095] A代表选自以下的基团：氢、甲基、乙基、丙基、二氟乙基、三氟乙基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、氰基甲基、烯丙基、炔丙基、环丙基或环丙基甲基，

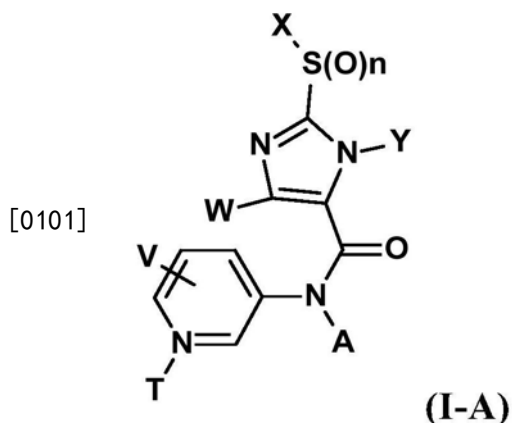
[0096] R²代表选自以下的基团：氢；甲基、乙基、丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、烯丙基、甲代烯丙基、2-丁烯基、炔丙基、2-丁炔基，其彼此独立地任选被氟、氯、甲氧基、乙氧基单取代至三取代；环丙基、环丁基、环戊基、环己基，其任选地被O、S(O)_m间隔一次，且彼此独立地任选被氟、氯、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、氰基单取代或二取代；环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基、环己基甲基，其任选地被O、S(O)_m间隔一次，且彼此独立地任选被氟、氯、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、氰基单取代或二取代；苯基或吡啶基，其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲硫基、三氟甲基亚磺酰基、三氟甲基磺酰基、二氟甲硫基、二氟甲基亚磺酰基、二氟甲基磺酰基、三氟乙硫基、三氟乙基亚磺酰基、三氟乙基磺酰基、硝基和氰基单取代或二取代；以及苄基、吡啶基甲基、嘧啶基甲基、噻唑基甲基，其彼此独立地任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、硝基和氰基单取代或二取代，

[0097] R³代表选自以下的基团：氢、甲基、乙基、丙基、异丙基、正丁基、异丁基和烯丙基，

[0098] R⁴代表选自以下的基团：氢；彼此独立地任选被氟、甲氧基、乙氧基、氰基、甲基、乙基、丙基、异丙基、正丁基、异丁基和烯丙基取代一至三次；以及代表基团CONR²R³和COR²，其中以上优选范围(4B)的定义适用于R²和R³，

[0099] T代表氧或电子对。

[0100] 在式(I)的化合物及其盐中，所示基团的非常特别优选的取代基或范围如下所示。它们的组合形成优选范围(5)。



[0102] V代表氢，

[0103] W代表选自以下的基团：氢、氯和溴，并且优选代表氢，

[0104] X代表选自以下的基团：甲基、乙基、正丁基、正戊基、正丙基、异丙基、烯丙基、3,3-二甲基烯丙基、炔丙基、环己基、四氢吡喃基、四氢噻喃基、3-氧杂环丁基、5-氧杂-[3.3.0]-双环庚基、甲氧基乙基、甲氧基丙基、乙氧基乙基、乙硫基乙基、甲硫基乙基、二氟甲基、三氟甲基、2,2,2-三氟乙基、3,3,3-三氟丙基、3-氯-2,2,3,3-四氟丙基、3-氟丙基、3,3-二氟丙基、2,2,2-三氟乙硫基乙基、甲基羰基甲基、环丙基羰基甲基、叔丁基羰基甲基、甲氧基羰基甲基、乙氧基羰基甲基、羟基羰基甲基、氨基甲酰基甲基、N-甲基氨基甲酰基甲基、N-环丙基氨基甲酰基甲基、N,N-二甲基氨基甲酰基甲基、2-甲氧基亚氨基丙基、环丙基甲基、苄基、4-甲基苄基、2-硝基苄基、3-甲硫基苄基、4-氯苄基、4-氟苄基、4-叔丁基苄基、4-甲氧基苄基、4-硝基苄基、4-二甲基氨基苄基、2-氟苄基、2-甲氧基苄基、2-二甲基氨基磺酰基苄基、2-二甲基氨基氨基甲酰基苄基、3-硝基苄基、3-三氟甲基苄基、3-氯苄基、2,5-二氯苄基、3,5-二氯苄基、4-氯-3-三氟甲基苄基、2,4,5-三氯苄基、2-吡啶基、5-(2-氯)吡啶基、2-(5-甲基)吡啶基、2-(6-甲基)吡啶基、2-(3-三氟甲基)吡啶基、2-嘧啶基、2-(4-甲基)嘧啶基、2-(5-甲基)嘧啶基、2-(4-甲氧基)嘧啶基、2-(5-氟)嘧啶基、2-(4-三氟甲基)嘧啶基、2-(5-三氟甲基)嘧啶基、2-(4,6-二甲基)嘧啶基、2-(4,5-二甲基)嘧啶基、2-(4,6-二甲氧基)嘧啶基、-CH₂-2-嘧啶基、-CH₂-2-吡嗪基、-CH₂-5-(1-甲基)咪唑基、-CH₂-3-(1-甲基)吡唑基、-CH₂-4-吡啶基、-CH₂-2-吡啶基、-CH₂-2-(1-甲基)咪唑基、-CH₂-3-吡啶基、-CH₂-2-呋喃基、-CH₂-5-(2-氯)吡啶基、苊基、3,4-二氯苊基、2,6-二氟苊基、2-氟-6-甲氧基苊基、2,6-二氯苊基、2-氯-6-三氟甲基苊基、2-氯-6-氟苊基、-CH₂-2-(4,6-二甲氧基)嘧啶基、2,6-二甲基苊基、-CH₂-1-(3-硝基-5-甲基)吡唑基、2-(1-甲基)苯并咪唑基、2-(5-甲基)噁二唑基、2-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4.5]吡啶基、3-[4-乙基-5-(三氟甲基)]-1,2,4-三唑基、3-[4-甲基-5-(三氟甲基)]-1,2,4-三唑基、3-[4-甲基-5-(二氟甲基)]-1,2,4-三唑基、2-(5-苄基)-1,3,4-噁二唑基、2-(1-甲基-5-苄基)咪唑基、2-(4,5-二甲基)噁唑基、2-(1-甲基-5-甲氧基羰基)咪唑基、2-(1-甲基)咪唑基、1,2-乙烷二基，

[0105] Y代表甲基、乙基或苄基，

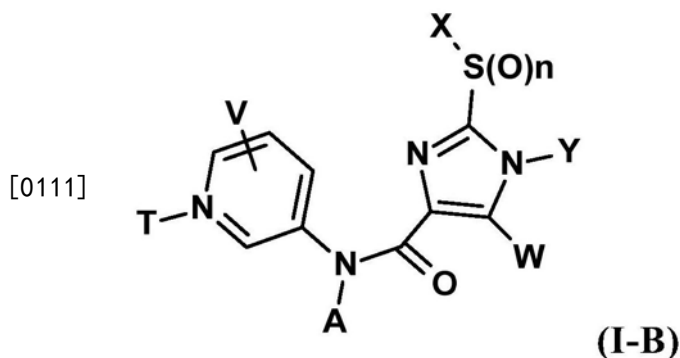
[0106] n代表数字0或2且优选代表0，

[0107] A代表选自氢和甲基的基团，且优选代表甲基，

[0108] T代表电子对

[0109] 以及

[0110] 式 (I-B) 的化合物



[0112] 其中

[0113] V代表氢，

[0114] W代表选自以下的基团：氢、氯和溴，且优选代表氢，

[0115] X代表选自以下的基团：4,6-二甲基嘧啶基、正丁基、正戊基、苄基、甲基、3-甲硫基苯基、2,2,2-三氟乙基、苯基、4-甲基苯基、2-嘧啶基、乙硫基乙基、2-硝基苯基、环丙基甲基，并且优选代表2-嘧啶基基团，

[0116] Y代表甲基，

[0117] n代表数字0或2，并且优选代表0，

[0118] A代表选自氢和甲基的基团，并且优选代表甲基，

[0119] T代表电子对。

[0120] 在优选范围 (1-5) 之一中，X和Y还可以与它们所连接的原子一起代表饱和或不饱和的环。优选地，X和Y与它们所连接的原子一起代表饱和或不饱和的5至7元环。非常特别优选地，X和Y与它们所连接的原子一起代表饱和的5元环。

[0121] 在优选范围 (1) 中，除非另有说明，

[0122] 卤素选自氟、氯、溴和碘，优选依次选自氟、氯和溴，

[0123] 杂芳基 (hetaryl) (与杂芳基 (heteroaryl) 同义，包括作为较大单元 (如杂芳基烷基) 的一部分的杂芳基) 选自呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、1,2,3-三唑基、1,2,4-三唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、1,2,3-噁二唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,5-噁二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,2,5-噻二唑基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、1,2,3-三嗪基、1,2,4-三嗪基、1,3,5-三嗪基、苯并呋喃基、苯并异呋喃基、苯并噻吩基、苯并异噻吩基、吲哚基、异吲哚基、吲唑基、苯并噻唑基、苯并异噻唑基、苯并噁唑基、苯并异噁唑基、苯并咪唑基、2,1,3-苯并噁二唑、喹啉基、异喹啉基、噌啉基、酞嗪基、喹唑啉基、喹喔啉基、萘啶基、苯并三嗪基、嘌呤基、蝶啶基和中氮茛基，

[0124] 杂环基代表饱和的3、4、5或6元环，其含有1或2个氮原子和/或一个氧原子和/或一个硫原子，但是其中2个氮原子不应直接相邻，例如氮杂环丙基、氮杂环丁基、氮杂环戊基 (azolidinyl)、氮杂环己基 (azinanyl)、氧杂环丙基、氧杂环丁基 (oxetanyl)、氧杂环戊基 (oxolanyl)、氧杂环己基 (oxanyl)、二氧杂环己基 (dioxanyl)、硫杂环丙基 (thiiranyl)、硫杂环丁基 (thietanyl)、硫杂环戊基 (thiolanyl)、硫杂环己基 (thianyl) 和四氢呋喃基。

[0125] 在优选范围 (2) 中，除非另有说明，

[0126] 卤素代表氟、氯、溴和碘,优选氟、氯和溴,

[0127] 杂芳基(包括作为较大单元(如杂芳基烷基)的一部分的杂芳基)代表吡啶基、嘧啶基、噻唑基、噁唑基、吡唑基、噻吩基、呋喃基、苕基、吡啶基甲基和噻唑基甲基,并且

[0128] 杂环基(包括作为较大单元(如杂环基烷基)的一部分的杂环基)代表饱和或不饱和的3、4或5元环,其含有1或2个氮原子和/或一个氧原子和/或一个硫原子,但是其中2个氮原子不应直接相邻,例如1-氮杂环丙基或2-氮杂环丙基、2-氧杂环丙基、2-硫杂环丙基、1-氮杂环丁基或2-氮杂环丁基、2-氧杂环丁基或3-氧杂环丁基、2-硫杂环丁基或3-硫杂环丁基、1,3-二氧杂环己-2-基、1-吡咯烷基、2-吡咯烷基或3-吡咯烷基。

[0129] 在优选范围(3)中,除非另有说明,

[0130] 卤素代表氟、氯、溴和碘,优选氟、氯和溴,以及

[0131] 杂环基(包括作为较大单元(如杂环基烷基)的一部分的杂环基)代表饱和或不饱和的3或4元环,其含有1或2个氮原子和/或一个氧原子和/或一个硫原子,但是其中2个氮原子不应直接相邻,例如1-氮杂环丙基或2-氮杂环丙基、2-氧杂环丙基、2-硫杂环丙基、1-氮杂环丁基或2-氮杂环丁基、2-氧杂环丁基或3-氧杂环丁基、2-硫杂环丁基或3-硫杂环丁基或者1,3-二氧杂环己-2-基。除非另有说明,卤素取代的基团(例如卤代烷基)为单卤代或多卤代(最高达可能的最大数目的取代基)。在多卤代的情况下,卤素原子可以相同或不同。在此情况下,卤素为氟、氯、溴或碘,尤其为氟、氯或溴。

[0132] 饱和或不饱和烃基(例如烷基或烯基)可各自为直链或支链的,如果可能,包括与杂原子组合,例如烷氧基。

[0133] 除非另有说明,任选取代的基团可为单取代或多取代的,其中在多取代的情况下,取代基可以相同或不同。

[0134] 在式(I)的化合物中,如果T代表氧,则这些化合物以N-氧化物的形式存在。

[0135] 在式(I)的化合物中,如果T代表电子对,则这些化合物以吡啶的形式存在。

[0136] 上述一般术语中或优选范围内给出的基团定义或说明适用于最终产物,并相应地适用于原料和中间体。这些基团定义可按需要彼此组合,即包括各优选范围之间的组合。

[0137] 根据本发明,优选使用式(I)的化合物,其含有上述作为优选所列出的含义(优选范围(1))的组合。

[0138] 根据本发明,特别优选使用式(I)的化合物,其含有上述作为特别优选所列出的含义(优选范围(2))的组合。

[0139] 根据本发明,非常特别优选使用式(I)的化合物,其含有上文作为非常特别优选所列出的定义(优选范围3A和/或3B)的组合。

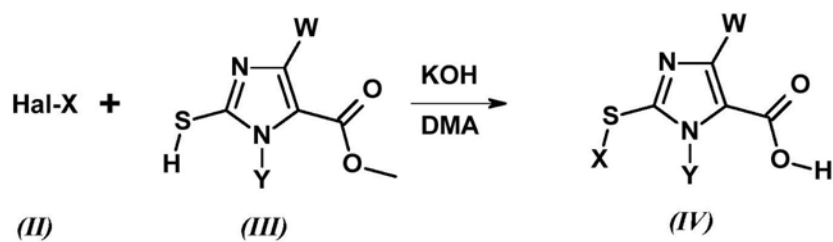
[0140] 根据本发明,尤其优选使用式(I)的化合物,其含有上文作为非常特别优选所列出的定义(优选范围4A和/或4B)的组合。

[0141] 根据本发明,甚至更优选使用式(I)的化合物,其含有上述作为非常特别优选所列出的含义(优选范围(5))的组合。

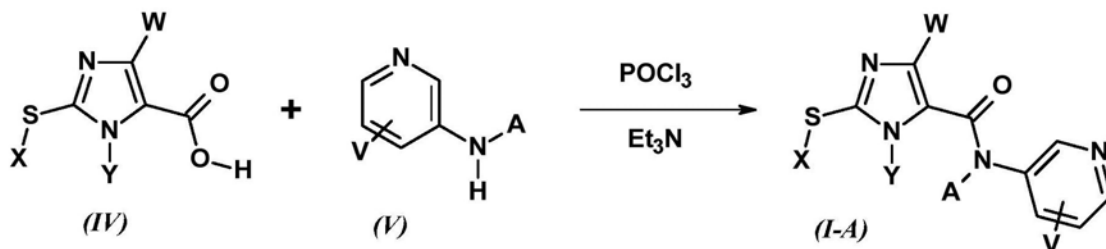
[0142] 根据取代基的性质,式(I)的化合物可为几何活性异构体和/或光学活性异构体或具有不同组成的相应异构体混合物。这些立体异构体为,例如对映体、非对映体、阻转异构体或几何异构体。因此,本发明包括纯的立体异构体和这些异构体的任何混合物。另外还发现,新的式(I)的化合物可通过下述方法来制备。

[0143] 式(I-A)的化合物可例如根据方法A至D来合成,如以下方案所示。

[0144] 方法A-1

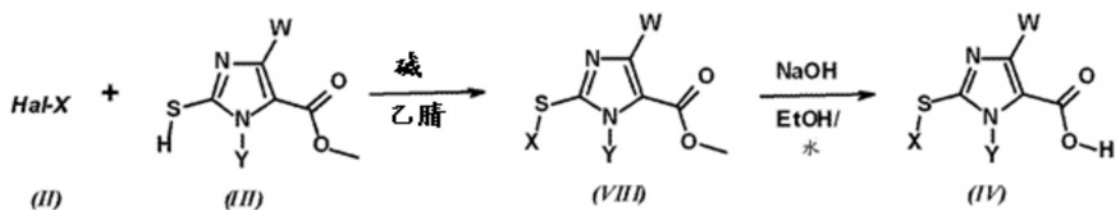


[0145]

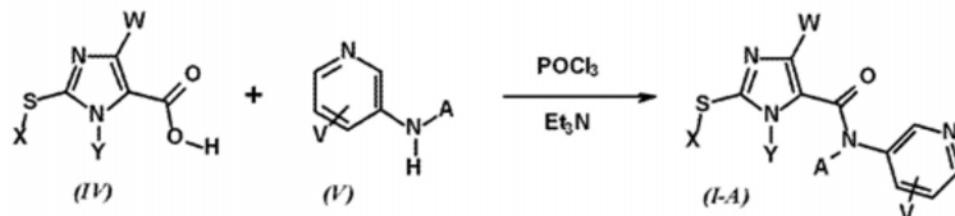


[0146] DMA=二甲基乙酰胺;Et₃N=三乙胺

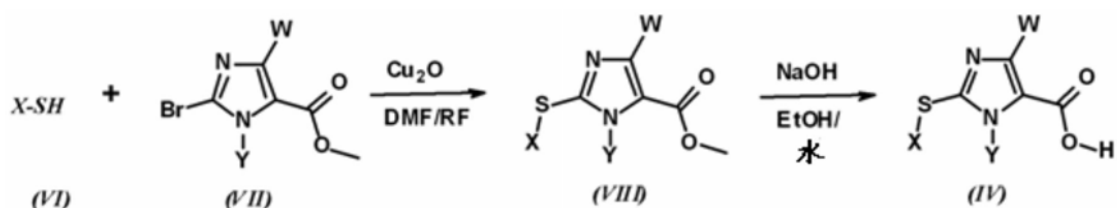
[0147] 方法A-2



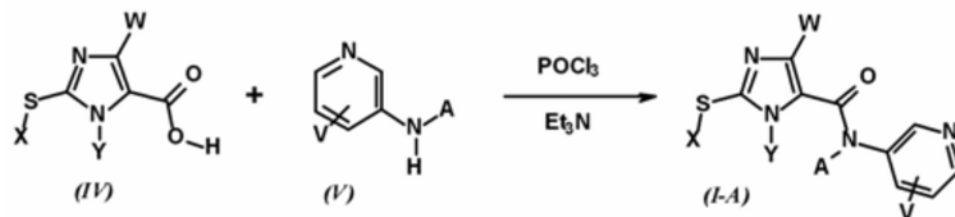
[0148]



[0149] 方法B

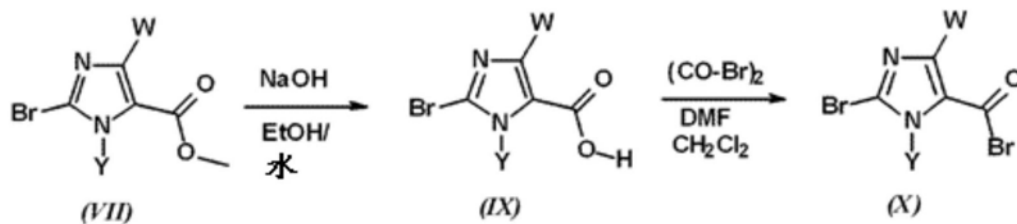


[0150]

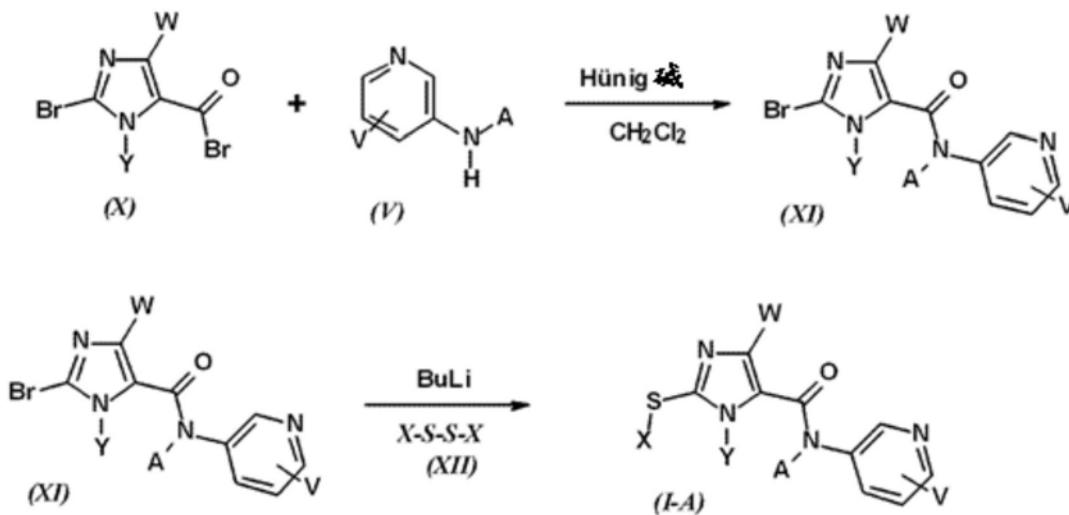


[0151] DMF=二甲基甲酰胺;Et₃N=三乙胺

[0152] 方法C-1



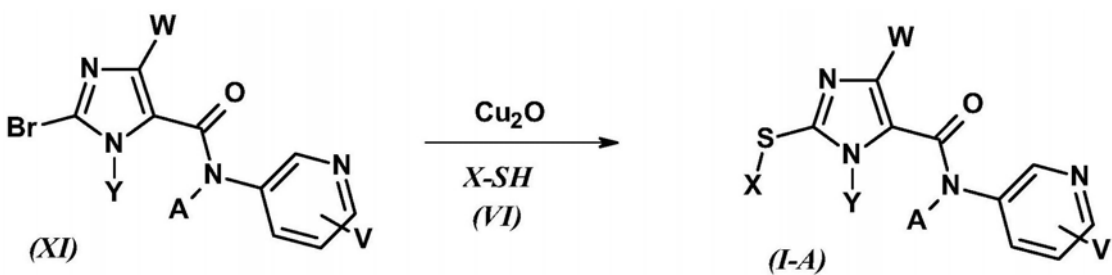
[0153]



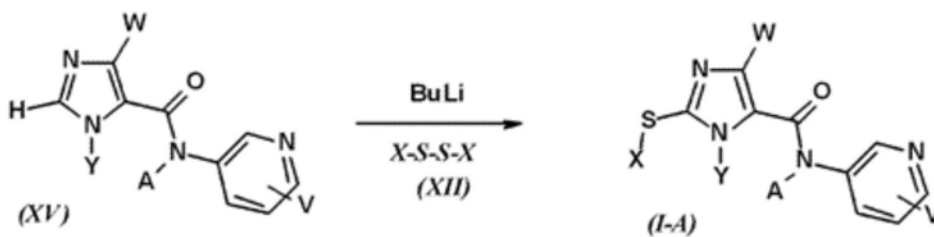
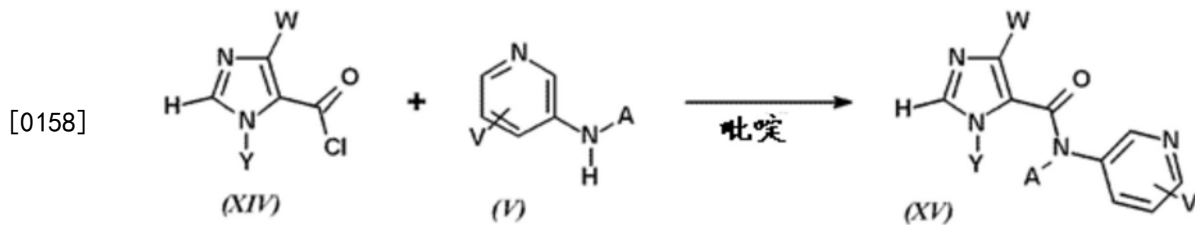
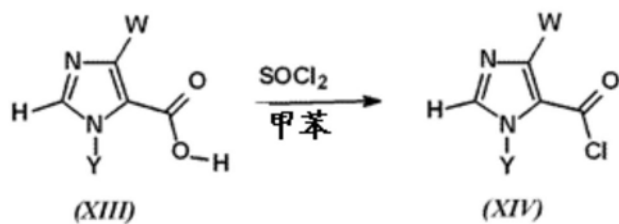
[0154] BuLi = 正丁基锂; Hünig碱 = N,N-二异丙基乙胺

[0155] 方法C-2

[0156]



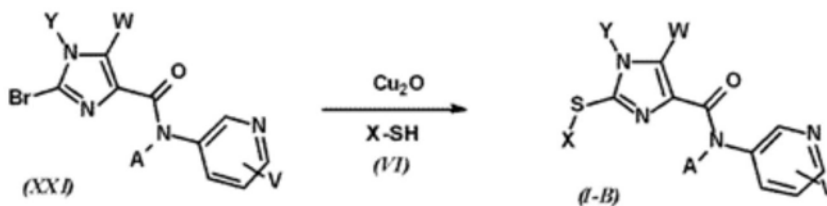
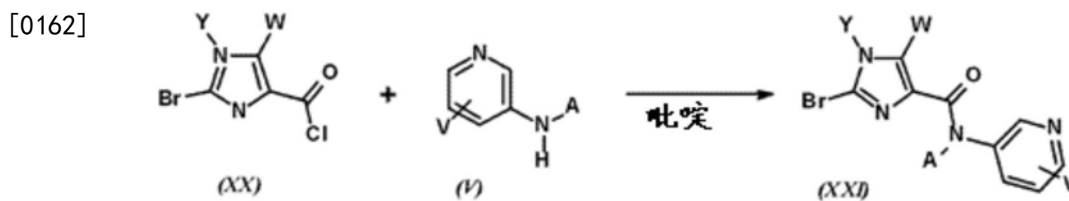
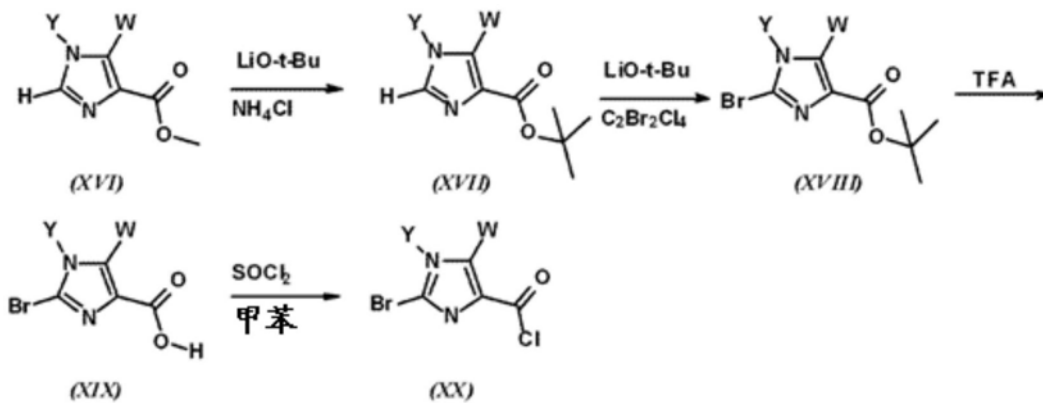
[0157] 方法D



[0159] BuLi = 正丁基锂

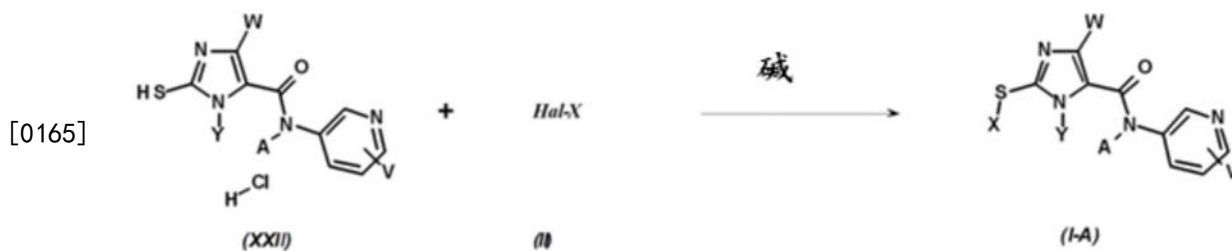
[0160] 式 (I-B) 的化合物可例如根据方法E来合成, 如以下方案所示。

[0161] 方法E

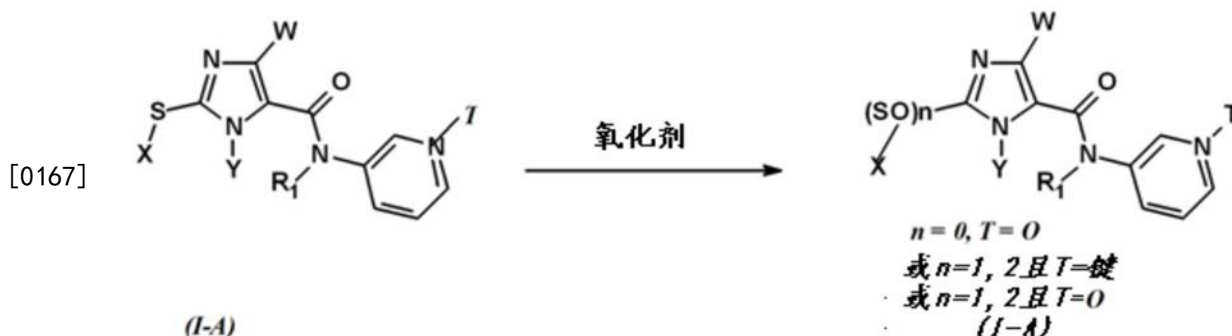


[0163] LiO-t-Bu=叔丁醇锂,TFA=三氟乙酸

[0164] 方法F



[0166] 方法G



[0168] 方法A所需的大多数式(II)的卤化物(例如烷基卤化物、杂芳基卤化物等)是市售产品,或者可通过有机化学中通常已知的方法制备。

[0169] 方法A所需的式(III)的2-巯基咪唑羧酸酯是市售可得的,或者可例如通过由文献(例如H.Rapoport等人;Synthesis 1988,10,767-771)已知的方法制备。

[0170] 方法B所需的大多数式(VI)的硫醇(例如烷基硫醇、苯硫酚、巯基嘧啶、巯基吡啶等)是市售可得的,或者可通过有机化学中通常已知的方法制备。

[0171] 方法B和C所需的式(VII)的2-溴咪唑羧酸酯是市售可得的,或者可例如通过由文献(例如H.Rapoport等人;Synthesis 1988,10,767-771)已知的方法制备。

[0172] 方法C-1和D所需的大多数式(XII)的二硫醚(例如嘧啶基二硫醚、吡啶基二硫醚等)是市售可得的,或者可通过有机化学中通常已知的方法(例如,Zeynizadeh,Behzad, Journal of Chemical Research-Part S, 2002, 564-566, Rütgerswerke Aktiengesellschaft patent:US4256892 A1,1981,Kesavan,Venkitasamy;Bonnet-Delpon,Daniele;Begue,Jean-Pierre Synthesis 2000,2,223-225)制备。

[0173] 方法D所需的式(XIII)的咪唑羧酸是市售可得的,或者可例如通过由文献(例如H.Rapoport等人, Synthesis 1988,10,767-771;BASF Aktiengesellschaft专利:US4864030 A1,1989,Takeda Pharmaceutical Company Limited专利:EP2530078 A1, 2012,TAISHO PHARMACEUTICAL CO.,LTD.专利:US2012/10414 A1,2012,Subrayan, Ramachandran P.;Thurber,Ernest L.;Rasmussen,Paul G.Tetrahedron,1994,50,2641-2656)已知的方法制备。

[0174] 方法E所需的式(XVI)的咪唑羧酸酯是市售可得的,或者可例如通过由文献(例如Nunami;Yamada;Fukui;Matsumoto,Journal of Organic Chemistry,1994,第59卷,7635-7642,H.Rapoport等人;Synthesis 1988,10,767-771)已知的方法制备。

[0175] 方法A至E所需的式(V)的3-氨基吡啶是市售可得的,或者可例如通过由文献(例如

Liu, Zhen-Jiang; Vors, Jean-Pierre; Gesing, Ernst R.F.; Bolm, Carsten, *Advanced Synthesis and Catalysis*, 2010, 352, 3158-3162, BAYER CROPSCIENCE AG 专利: US2010/305124 A1, 2010, Shafir, Alexandr; Buchwald, Stephen L., *Journal of the American Chemical Society*, 2006, 128, 8742-8743) 已知的方法制备。

[0176] 从方法方案A至E可以看出, 式(I-A)和(I-B)的化合物原则上可在最后阶段通过酰胺化方法或偶联方法获得。

[0177] 酰胺化方法

[0178] 在本发明的方法A至E中, 式(I-A)的化合物以及式(XI)、(XV)和(XXI)的中间体可使用由文献已知或与所明确提及的实施例类似的酰胺化反应来合成。

[0179] 用于酰胺化步骤的许多反应条件记载于下列文献中: 例如G. Benz在 *Comprehensive Organic Synthesis*, 第1版, Pergamon Press, Oxford, 1991, 第6卷, 第381-417页中所记载的; P.D. Bailey等人在 *Comprehensive Organic Functional Group Transformation*, 第1版, Elsevier Science Ltd., Oxford, 1995, 第5卷, 第257-308页中所记载的; 以及R.C. Larock在 *Comprehensive Organic Transformations*, 第2版, Wiley-VCH, New York, Weinheim, 1999, 第1929-1994页中所记载的。这些反应的一些通过中间体碳酰氯进行, 所述碳酰氯可以以分离的形式或以原位生成的形式使用。

[0180] 酰胺化反应任选地在缩合剂的存在下、任选地在酸受体的存在下以及任选地在溶剂的存在下进行。

[0181] 有用的缩合剂是常用于这种酰胺化反应的所有缩合剂。实例包括活化剂如光气、三氯化磷、三氯氧化磷、草酰氯、草酰溴或亚硫酸氯; 碳二亚胺如N,N'-二环己基碳二亚胺(DCC)和1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳二亚胺(EDCI); 或其他常规缩合剂如五氧化二磷、多磷酸、N,N'-羰基二咪唑、2-氯吡啶1-甲碘化物(向山试剂)、2-乙氧基-N-乙氧基羰基-1,2-二氢喹啉(EEDQ)、三苯基膦/四氯化碳、溴代三吡咯烷磷六氟磷酸盐(BROP)、O-(1H-苯并三唑-1-基氧基)三(二甲基氨基)磷六氟磷酸盐(BOP)、N,N,N',N'-双(四亚甲基)氯脲四氟硼酸盐(N,N,N',N'-bis(tetramethylene)chlorouronium tetrafluoroborate)、O-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲六氟磷酸盐(HBTU)、O-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-双(四亚甲基)脲六氟磷酸盐、O-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲四氟硼酸盐(TBTU)、O-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-双(四亚甲基)脲四氟硼酸盐、O-(7-氮杂苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲六氟磷酸盐(HATU)、1-羟基苯并三唑(HOBt)和4-(4,6-二甲氧基-1,3,5-三嗪-2-基)-4-甲基吗啉盐(DMT.MM), 通常可作为氯化物获得。这些试剂可以单独使用或组合使用。

[0182] 合适的酸受体是所有常规的无机碱或有机碱, 例如有机胺, 如三乙胺、二异丙基乙胺、N-甲基吗啉、吡啶或N,N-二甲基氨基吡啶; 碱金属和碱土金属碳酸盐, 如碳酸锂、碳酸钠、碳酸钾或碳酸铯; 碱金属碳酸氢盐, 如碳酸氢钠或碳酸氢钾。在本发明的方法中, 酰胺化反应任选地在合适的反应助剂的存在下进行, 所述反应助剂例如, N,N-二甲基甲酰胺或N,N-二甲基氨基吡啶。合适的溶剂或稀释剂是所有的惰性有机溶剂, 例如脂族烃或芳族烃(例如石油醚、甲苯、环己烷)、卤代烃(例如氯甲苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、1,2-二氯乙烷)、醚(例如乙醚、二氧杂环己烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷)、酯(例如乙酸乙酯或乙酸甲酯)、硝基烃类(例如硝基甲烷、硝基乙烷、硝基苯)、腈(例如乙腈、丙腈、丁腈、苄腈)、酰胺类(例

如N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基甲酰苯胺、N-甲基吡咯烷酮、六甲基磷酰胺),以及二甲基亚砷或水或所述溶剂的混合物。

[0183] 还可以使用混合酸酐来制备式(III)的化合物(参见J. Am. Chem. Soc. 1967, 5012)。在该方法中,可以使用氯甲酸酯,例如氯甲酸甲酯、氯甲酸乙酯、氯甲酸异丁酯和氯甲酸异丙酯。同样地,为此还可以使用二乙基乙酰氯、三甲基乙酰氯和类似的化合物。

[0184] 偶联方法变型A

[0185] 在本发明的方法B、C-2和E中,式(I-A)和(I-B)的化合物以及式(VIII)的中间体可使用由文献已知或与所明确提及的实施例类似的偶联反应来合成。

[0186] 用于过渡金属催化的偶联方法变型A的许多反应条件已有记载,例如J. P. Dickens等人;Journal of Organic Chemistry, 1981, 46, 1781及之后页.Harr, Molly S.;Presley, Alice L.;Thorarensen, Atli;Synlett;nb.10; (1999);第1579-158页.Babu, S. Ganesh;Karvembu, Tetrahedron Letters, 2013, 第54卷, #13, 第1677-1680页。

[0187] 偶联反应任选地在过渡金属的存在下、任选地在酸受体的存在下且任选地在溶剂的存在下进行。

[0188] 溶剂的实例包括:N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、四氢呋喃、甲苯。

[0189] 金属化合物的实例包括:氧化亚铜(I)、氧化铜(II)、四(三苯基膦)钯(0)、三(二亚苺基丙酮)二钯(0)。

[0190] 碱的实例包括:氢氧化钾、叔丁醇钾、三乙胺;以及所有常规的无机碱或有机碱,例如有机胺,如二异丙基乙胺、N-甲基吗啉、吡啶或N,N-二甲基氨基吡啶;碱金属和碱土金属碳酸盐,例如碳酸锂、碳酸钠、碳酸钾或碳酸铯;碱金属碳酸氢盐,例如碳酸氢钠或碳酸氢钾。

[0191] 偶联方法变型B

[0192] 在本发明的方法C-1和D中,式(I-A)的化合物可使用由文献已知或与所明确提及的实施例类似的偶联反应来合成。

[0193] 用于锂化偶联方法变型B的许多反应条件已有记载,例如Hoechst Aktiengesellschaft, 专利:US4764624A1, 1988. Ohta; Yamamoto; Kawasaki; Yamashita; Katsuma; Nasako; Kobayashi; Ogawa, Chemical and Pharmaceutical Bulletin, 1992, 第40卷, #10第2681-2685页.Hara, Kenji; Iwahashi, Keiji; Kanamori, Yoshikazu; Naito, Satoshi; Takakusagi, Satoru; Uosaki, Kohei; Sawamura, Masaya Chemistry Letters, 2006, 第35卷, #8第870-871页。

[0194] 溶剂的实例包括:乙醚、四氢呋喃。

[0195] 锂化剂的实例包括:正丁基锂、二异丙基氨基锂、叔丁醇锂。

[0196] 初始锂化步骤的反应温度任选地在-100至-75°C之间。

[0197] 方法和用途

[0198] 本发明还涉及防治动物害虫的方法,其中使式(I)的化合物作用于动物害虫和/或其生境。动物害虫的防治优选在农业和林业以及材料保护中进行。优选从中排除的是用于人体或动物体的外科或治疗性治疗的方法以及在人体或动物体上进行的诊断方法。

[0199] 本发明还涉及式(I)的化合物作为农药、尤其是作物保护剂的用途。

[0200] 在本申请的上下文中,术语“农药”还总是包括术语“作物保护剂”。

[0201] 鉴于良好的植物耐受性、对温血生物有利的毒性和良好的环境相容性,式(I)的化合物适于保护植物和植物器官抵抗生物和非生物胁迫因素;增加采收产量;提高采收材料的品质;以及防治在农业、园艺业、畜牧业、水产养殖业、林业、花园以及休闲设施、贮存产品和材料的保护和卫生领域中遇到的动物害虫,尤其是昆虫、蛛形纲动物、蠕虫、线虫及软体动物。它们优选可用作农药。它们对通常敏感的抗性物种以及对全部或某些发育阶段有活性。上述害虫包括:

[0202] 来自节肢动物门(Anthropoda)的害虫,尤其是来自蛛形纲(Arachnida)的害虫,例如,粉螨属种(*Acarus* spp.) (例如粗脚粉螨(*Acarus siro*))、枸杞瘤瘿螨(*Aceria kuko*)、柑橘瘤瘿螨(*Aceria sheldoni*)、刺皮瘿螨属种(*Aculops* spp.)、刺瘿螨属种(*Aculus* spp.) (例如佛氏刺瘿螨(*Aculus fockeui*)、苹果刺瘿螨(*Aculus schlechtendali*))、花蜱属种(*Amblyomma* spp.)、山楂叶螨(*Amphitetranychus viennensis*)、锐缘蜱属种(*Argas* spp.)、牛蜱属种(*Boophilus* spp.)、短须螨属种(*Brevipalpus* spp.) (例如紫红短须螨(*Brevipalpus phoenicis*))、*Bryobia graminum*、苜蓿苔螨(*Bryobia praetiosa*)、刺尾蝎属种(*Centruroides* spp.)、足螨属种(*Chorioptes* spp.)、鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*)、屋尘螨(*Dermatophagoides pteronyssinus*)、粉尘螨(*Dermatophagoides farinae*)、革蜱属种(*Dermacentor* spp.)、始叶螨属种(*Eotetranychus* spp.) (例如核桃始叶螨(*Eotetranychus hicoriae*))、梨上瘿螨(*Epitrimerus pyri*)、真叶螨属种(*Eutetranychus* spp.) (例如班氏真叶螨(*Eutetranychus banksi*))、瘿螨属种(*Eriophyes* spp.) (例如梨瘿螨(*Eriophyes pyri*))、家甜食螨(*Glycyphagus domesticus*)、红足海镰螯螨(*Halotydeus destructor*)、半跗线螨属种(*Hemitarsonemus* spp.) (例如茶半跗线螨(*Hemitarsonemus latus*) (=侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonemus latus*)))、璃眼蜱属种(*Hyalomma* spp.)、硬蜱属种(*Ixodes* spp.)、毒蛛属种(*Latrodectus* spp.)、斜蛛属种(*Loxosceles* spp.)、秋收恙螨(*Neutrombicula autumnalis*)、*Nuphresa*属种、小爪螨属种(*Oligonychus* spp.) (例如*Oligonychus coniferarum*、冬青小爪螨(*Oligonychus ilicis*)、甘蔗小爪螨(*Oligonychus indicus*)、芒果小爪螨(*Oligonychus mangiferus*)、草地小爪螨(*Oligonychus pratensis*)、石榴小爪螨(*Oligonychus punicae*)、樟小爪螨(*Oligonychus yothersi*))、钝缘蜱属种(*Ornithodoros* spp.)、禽刺螨属种(*Ornithonyssus* spp.)、全爪螨属种(*Panonychus* spp.) (例如柑桔全爪螨(*Panonychus citri*) (=Metatetranychus citri)、苹果全爪螨(*Panonychus ulmi*) (=Metatetranychus ulmi))、桔芸锈螨(*Phyllocoptruta oleivora*)、多趾宽叶螨(*Platytetranychus multidigituli*)、侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonemus latus*)、痒螨属种(*Psoroptes* spp.)、扇头蜱属种(*Rhipicephalus* spp.)、根螨属种(*Rhizoglyphus* spp.)、疥螨属种(*Sarcoptes* spp.)、中东金蝎(*Scorpio maurus*)、狭跗线螨属种(*Stenotarsonemus* spp.)、稻细螨(*Steneotarsonemus spinki*)、跗线螨属种(*Tarsonemus* spp.) (例如乱跗线螨(*Tarsonemus confusus*)、白跗线螨(*Tarsonemus pallidus*))、叶螨属种(*Tetranychus* spp.) (例如加拿大叶螨(*Tetranychus canadensis*)、朱砂叶螨(*Tetranychus cinnabarinus*)、土耳其斯坦叶螨(*Tetranychus turkestanii*)、二斑叶螨(*Tetranychus urticae*))、阿氏真恙螨(*Trombicula alfreddugesi*)、*Vaejovis*属种、番茄斜背瘤瘿螨(*Vasates lycopersici*);

[0203] 来自唇足纲(Chilopoda)的害虫,例如地蜈蚣属种(*Geophilus* spp.)、蚰蜒属种(*Scutigera* spp.);

[0204] 来自弹尾目或弹尾纲(Collembola)的害虫,例如武装棘跳虫(*Onychiurus armatus*)、绿圆跳虫(*Sminthurus viridis*);

[0205] 来自倍足纲(Diplopoda)的害虫,例如千足虫(*Blaniulus guttulatus*);

[0206] 来自昆虫纲的害虫,例如来自蜚蠊目(Blattodea)的害虫,例如东方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、亚洲蜚蠊(*Blattella asahinai*)、德国小蠊(*Blattella germanica*)、马德拉蜚蠊(*Leucophaea maderae*)、*Loboptera decipiens*、家屋斑蠊(*Neostylopyga rhombifolia*)、古巴蠊属种(*Panchlora* spp.)、木蠊属种(*Parcoblatta* spp.)、大蠊属种(*Periplaneta* spp.) (例如美洲大蠊(*Periplaneta americana*)、澳洲大蠊(*Periplaneta australasiae*))、苏里南潜蠊(*Pycnoscelus surinamensis*)、棕带蜚蠊(*Supella longipalpa*);

[0207] 来自鞘翅目(Coleoptera)的害虫,例如,条纹叶甲(*Acalymma vittatum*)、菜豆象(*Acanthoscelides obtectus*)、喙丽金龟属种(*Adoretus* spp.)、蜂房小甲虫(*Aethina tumida*)、杨树莹叶甲(*Agelastica alni*)、叩甲属种(*Agriotes* spp.) (例如直条叩头虫(*Agriotes linneatus*)、小麦金针虫(*Agriotes mancus*))、黑菌虫(*Alphitobius diaperinus*)、六月金龟子(*Amphimallon solstitialis*)、家具窃蠹(*Anobium punctatum*)、星天牛属种(*Anoplophora* spp.)、花象属种(*Anthonomus* spp.) (例如墨西哥棉铃象(*Anthonomus grandis*))、圆皮蠹属种(*Anthrenus* spp.)、梨象属种(*Apion* spp.)、甘蔗金龟属种(*Apogonia* spp.)、隐翅甲属种(*Atomaria* spp.) (例如甜菜隐食甲(*Atomaria linearis*))、毛皮蠹属种(*Attagenus* spp.)、*Baris caerulescens*、恶条豆象(*Bruchidius obtectus*)、豆象属种(*Bruchus* spp.) (例如豌豆象(*Bruchus pisorum*)、蚕豆象(*Bruchus rufimanus*))、龟甲属种(*Cassida* spp.)、菜豆莹叶甲(*Cerotoma trifurcata*)、龟象属种(*Ceuthorhynchus* spp.) (例如白菜籽龟象(*Ceutorrhynchus assimilis*)、甘蓝茎龟象(*Ceutorrhynchus quadridens*)、白菜龟象(*Ceutorrhynchus rapae*))、凹胫跳甲属种(*Chaetocnema* spp.) (例如甘薯跳甲(*Chaetocnema confinis*)、美国齿跳甲(*Chaetocnema denticulata*)、玉米跳甲(*Chaetocnema ectypa*))、*Cleonus mendicus*、宽胸叩头虫属种(*Conoderus* spp.)、根颈象属种(*Cosmopolites* spp.) (例如香蕉黑象(*Cosmopolites sordidus*))、新西兰草地蛱蛄(*Costelytra zealandica*)、叩甲属种(*Ctenicera* spp.)、象虫属种(*Curculio* spp.) (例如美核桃象(*Curculio caryae*)、大栗象(*Curculio caryatrypes*)、榛子象甲(*Curculio obtusus*)、小栗象(*Curculio sayi*))、锈赤扁谷盗(*Cryptolestes ferrugineus*)、长角扁谷盗(*Cryptolestes pusillus*)、杨干象隐喙象(*Cryptorhynchus lapathi*)、印度果核芒果象(*Cryptorhynchus mangiferae*)、细枝象属种(*Cylindrocopturus* spp.)、密点细枝象(*Cylindrocopturus adspersus*)、*Cylindrocopturus furnissi*、皮蠹属种(*Dermestes* spp.)、叶甲属种(*Diabrotica* spp.) (例如黄瓜条叶甲(*Diabrotica balteata*)、北方玉米根叶甲(*Diabrotica barberi*)、十一星瓜叶甲(*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、黄瓜十一星瓜叶甲(*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*)、西方玉米根叶甲(*Diabrotica virgifera virgifera*)、墨西哥玉米根叶甲(*Diabrotica virgifera zea*))、蛀野螟属种

(*Dichocrocis* spp.)、水稻铁甲(*Di cladispa armigera*)、*Diloboderus*属种、*Epicaerus*属种、食植瓢虫属种(*Epilachna* spp.) (例如南瓜瓢虫(*Epilachna borealis*)、墨西哥豆瓢虫(*Epilachna varivestis*))、毛跳甲属种(*Epitrix* spp.) (例如黄瓜跳甲(*Epitrix cucumeris*)、茄跳甲(*Epitrix fuscula*)、烟草跳甲(*Epitrix hirtipennis*)、美国马铃薯跳甲(*Epitrix subcrinita*)、块茎跳甲(*Epitrix tuberis*))、钻孔虫属种(*Faustinus* spp.)、裸蛛甲(*Gibbium psylloides*)、阔角谷盗(*Gnathocerus cornutus*)、菜心野螟(*Hellula undalis*)、黑异爪蔗金龟(*Heteronychus arator*)、寡节鳃金龟属种(*Heteronyx* spp.)、*Hylamorpha elegans*、北美家天牛(*Hylotrupes bajulus*)、紫苜蓿叶象(*Hypera postica*)、蓝绿象(*Hypomeces squamosus*)、咪小蠹属种(*Hypothenemus* spp.) (例如咖啡果小蠹(*Hypothenemus hampei*)、暗咪小蠹(*Hypothenemus obscurus*)、*Hypothenemus pubescens*)、甘蔗大褐齿爪鳃金龟(*Lachnosterna consanguinea*)、烟草甲(*Lasioderma serricorne*)、长头谷盗(*Latheticus oryzae*)、长头谷盗属种(*Lathridius* spp.)、合爪负泥虫属种(*Lema* spp.)、马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata*)、银潜蛾属种(*Leucoptera* spp.) (例如咖啡潜叶蛾(*Leucoptera coffeella*))、稻根象(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、卜象(*Listronotus*=*Hyperodes*)属种、筒喙象属种(*Lixus* spp.)、黄胸寡毛跳甲(*Luperomorpha xanthodera*)、萤叶甲属种(*Luperodes* spp.)、粉蠹属种(*Lyctus* spp.)、美洲叶甲属种(*Megascelis* spp.)、梳爪叩头虫属种(*Melanotus* spp.) (例如 *Melanotus longulus oregonensis*)、油菜花露尾甲(*Meligethes aeneus*)、鳃金龟属种(*Melolontha* spp.) (例如大栗鳃角金龟(*Melolontha melolontha*))、*Migdolus*属种、墨天牛属种(*Monochamus* spp.)、*Naupactus xanthographus*、隐跗郭公虫属种(*Necrobia* spp.)、*Neogalerucella*属种、黄蛛甲(*Niptus hololeucus*)、椰蛀犀金龟(*Oryctes rhinoceros*)、锯谷盗(*Oryzaephilus surinamensis*)、*Oryzaphagus oryzae*、耳象属种(*Otiorrhynchus* spp.) (例如苹果耳象(*Otiorrhynchus cribricollis*)、苜蓿象鼻虫(*Otiorrhynchus ligustici*)、草莓根耳象(*Otiorrhynchus ovatus*)、粗糙草莓耳喙象(*Otiorrhynchus rugosostriatus*)、黑葡萄耳象(*Otiorrhynchus sulcatus*))、负泥虫属种(*Oulema* spp.)、水稻负泥虫(*Oulema oryzae*)、小青花金龟(*Oxycetonia jucunda*)、辣根猿叶虫(*Phaedon cochleariae*)、食叶鳃金龟属种(*Phyllophaga* spp.)、鳃金龟(*Phyllophaga helleri*)、条跳甲属种(*Phyllotreta* spp.) (例如辣根跳甲(*Phyllotreta armoraciae*)、美拉黑跳甲(*Phyllotreta pusilla*)、美条纹跳甲(*Phyllotreta ramosa*)、黄曲条跳甲(*Phyllotreta striolata*))、日本弧丽金龟(*Popillia japonica*)、象甲属种(*Premnotrypes* spp.)、大谷蠹(*Prostephanus truncatus*)、跳甲属种(*Psylliodes* spp.) (例如 *Psylliodes affinis*、油菜兰跳甲(*Psylliodes chrysocephala*)、忽布跳甲(*Psylliodes punctulata*))、蛛甲属种(*Ptinus* spp.)、暗色瓢虫(*Rhizobius ventralis*)、谷蠹(*Rhizopertha dominica*)、隐喙象属种(*Rhynchophorus* spp.) (红棕象甲(*Rhynchophorus ferrugineus*)、棕榈象甲(*Rhynchophorus palmarum*))、侧突双棘长蠹(*Sinoxylon perforans*)、米象属种(*Sitophilus* spp.) (例如小麦象鼻虫(*Sitophilus granarius*)、罗望子果象(*Sitophilus linearis*)、米象(*Sitophilus oryzae*)、玉米象(*Sitophilus zeamais*))、尖隐喙象属种(*Sphenophorus* spp.)、药材甲(*Stegobium paniceum*)、茎干象属种(*Sternechus* spp.) (例如豆茎象(*Sternechus paludatus*))、宽幅

天牛属种 (*Symphyletes* spp.)、纤毛象属种 (*Tanymecus* spp.) (例如双宽隆突纤毛象 (*Tanymecus dilaticollis*)、印度纤毛象 (*Tanymecus indicus*)、甜菜灰象虫 (*Tanymecus palliatus*))、黄粉虫 (*Tenebrio molitor*)、大谷盗 (*Tenebrioides mauretanicus*)、拟谷盗属种 (*Tribolium* spp.) (例如美洲黑拟谷盗 (*Tribolium audax*)、赤拟谷盗 (*Tribolium castaneum*)、杂拟谷盗 (*Tribolium confusum*))、斑皮蠹属种 (*Trogoderma* spp.)、籽象属种 (*Tychius* spp.)、脊虎天牛属种 (*Xylotrechus* spp.)、距步甲属种 (*Zabrus* spp.) (例如 *Zabrus tenebrioides*)；

[0208] 来自革翅目的害虫，例如 *Anisolabis maritime*、欧洲球蝮 (*Forficula auricularia*)、溪岸蝮 (*Labidura riparia*)；

[0209] 来自双翅目 (*Diptera*) 的害虫，例如，伊蚊属种 (*Aedes* spp.) (例如埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*)、白纹伊蚊 (*Aedes albopictus*)、叮刺伊蚊 (*Aedes sticticus*)、刺扰伊蚊 (*Aedes vexans*))、潜蝇属种 (*Agromyza* spp.) (例如苜蓿斑潜蝇 (*Agromyza frontella*)、美洲黍潜蝇 (*Agromyza parvicornis*))、按实蝇属种 (*Anastrepha* spp.)、按蚊属种 (*Anopheles* spp.) (例如四斑按蚊 (*Anopheles quadrimaculatus*)、冈比亚按蚊 (*Anopheles gambiae*))、瘿蚊属种 (*Asphondylia* spp.)、果实蝇属种 (*Bactrocera* spp.) (例如瓜实蝇 (*Bactrocera cucurbitae*)、东方果实蝇 (*Bactrocera dorsalis*)、油橄榄果实蝇 (*Bactrocera oleae*))、花园毛蚊 (*Bibio hortulanus*)、琉璃蝇 (*Calliphora erythrocephala*)、红头丽蝇 (*Calliphora vicina*)、地中海实蝇 (*Ceratitis capitata*)、摇蚊属种 (*Chironomus* spp.)、金蝇属种 (*Chrysomya* spp.)、斑虻属种 (*Chrysops* spp.)、高额麻虻 (*Chrysozona pluvialis*)、锥蝇属种 (*Cochliomyia* spp.)、康瘿蚊属种 (*Contarinia* spp.) (例如葡萄瘿蚊 (*Contarinia johnsoni*)、甘蓝瘿蚊 (*Contarinia nasturtii*)、梨瘿蚊 (*Contarinia pyrivora*)、向日葵瘿蚊 (*Contarinia schulzi*)、高粱瘿蚊 (*Contarinia sorghicola*)、麦黄瘿蚊 (*Contarinia tritici*))、人皮蝇 (*Cordylobia anthropophaga*)、*Cricotopus sylvestris*、库蚊属种 (*Culex* spp.) (例如尖音库蚊 (*Culex pipiens*)、致乏库蚊 (*Culex quinquefasciatus*))、库蠓属种 (*Culicoides* spp.)、脉毛蚊属种 (*Culiseta* spp.)、黄蝇属种 (*Cuterebra* spp.)、橄榄实蝇 (*Dacus oleae*)、叶瘿蚊属种 (*Dasyneura* spp.) (例如油菜叶瘿蚊 (*Dasyneura brassicae*))、地种蝇属种 (*Delia* spp.) (例如葱地种蝇 (*Delia antiqua*)、麦地种蝇 (*Delia coarctata*)、毛跗地种蝇 (*Delia florilega*)、灰地种蝇 (*Delia platura*)、甘蓝地种蝇 (*Delia radicum*))、人肤蝇 (*Dermatobia hominis*)、果蝇属种 (*Drosophila* spp.) (例如黄猩猩果蝇 (*Drosophila melanogaster*)、樱桃果蝇 (*Drosophila suzukii*))、稻象属种 (*Echinocnemus* spp.)、*Euleia heraclei*、厕蝇属种 (*Fannia* spp.)、胃蝇属种 (*Gastrophilus* spp.)、舌蝇属种 (*Glossina* spp.)、麻虻属种 (*Haematopota* spp.)、毛眼水蝇属种 (*Hydrellia* spp.)、水稻潜叶蝇 (*Hydrellia griseola*)、黑蝇属种 (*Hylemya* spp.)、虱蝇属种 (*Hippobosca* spp.)、皮蝇属种 (*Hypoderma* spp.)、斑潜蝇属种 (*Liriomyza* spp.) (例如菜斑潜蝇 (*Liriomyza brassicae*)、南美斑潜蝇 (*Liriomyza huidobrensis*)、美洲斑潜蝇 (*Liriomyza sativae*))、绿蝇属种 (*Lucilia* spp.) (例如铜绿蝇 (*Lucilia cuprina*))、罗岭属种 (*Lutzomyia* spp.)、曼蚊属种 (*Mansonia* spp.)、家蝇属种 (*Musca* spp.) (例如家蝇 (*Musca domestica*)、舍蝇 (*Musca domestica vicina*))、狂蝇属种 (*Oestrus* spp.)、瑞典麦茎蝇 (*Oscinella frit*)、*Paratanytarsus* 属

种、*Paralauterborniella subcincta*、泉蝇属种 (*Pegomya* spp.) (例如甜菜泉蝇 (*Pegomya betae*)、甜菜潜叶蝇 (*Pegomya hyoscyami*)、悬钩子泉蝇 (*Pegomya rubivora*))、白蛉属种 (*Phlebotomus* spp.)、草种蝇属种 (*Phorbia* spp.)、伏蝇属种 (*Phormia* spp.)、酪蝇 (*Piophilha casei*)、芦笋突额实蝇 (*Platyparea poeciloptera*)、*Prodiplosis*属种、胡萝卜茎蝇 (*Psila rosae*)、绕实蝇属种 (*Rhagoletis* spp.) (例如白带樱桃实蝇 (*Rhagoletis cingulata*)、核桃绕实蝇 (*Rhagoletis completa*)、黑樱桃实蝇 (*Rhagoletis fausta*)、西部樱桃实蝇 (*Rhagoletis indifferens*)、越桔绕实蝇 (*Rhagoletis mendax*)、苹果实蝇 (*Rhagoletis pomonella*))、麻蝇属种 (*Sarcophaga* spp.)、蚋属种 (*Simulium* spp.) (例如南方蚋 (*Simulium meridionale*))、螫蝇属种 (*Stomoxys* spp.)、虻属种 (*Tabanus* spp.)、根斑蝇属种 (*Tetanops* spp.)、大蚊属种 (*Tipula* spp.) (例如欧洲大蚊 (*Tipula paludosa*)、牧场大蚊 (*Tipula simplex*))、木瓜状实蝇 (*Toxotrypana curvicauda*) ;

[0210] 来自半翅目 (Hemiptera) 的害虫,例如 *Acizzia acaciaebaileyanae*、*Acizzia dodonaeae*、*Acizzia uncatoides*、长头蝗 (*Acrida turrita*)、无网长管蚜属种 (*Acyrtosiphon* spp.) (例如豌豆长管蚜 (*Acyrtosiphon pisum*))、*Acrogonia*属种、*Aeneolamia*属种、隆脉木虱属种 (*Agonoscena* spp.)、刺粉虱属种 (*Aleurocanthus* spp.)、欧洲甘蓝粉虱 (*Aleyrodes proletella*)、蔗粉穴粉虱 (*Aleurolobus barodensis*)、软毛粉虱 (*Aleurothrixus floccosus*)、*Allocaridara malayensis*、芒果叶蝉属种 (*Amrasca* spp.) (例如 *Amrasca bigutulla*、叶蝉 (*Amrasca devastans*))、飞廉短尾蚜 (*Anuraphis cardui*)、肾圆盾蚧属种 (*Aonidiella* spp.) (例如红肾圆盾蚧 (*Aonidiella aurantii*)、黄肾圆盾蚧 (*Aonidiella citrina*)、杂食肾圆盾蚧 (*Aonidiella inornata*))、梨瘤蚜 (*Aphanostigma piri*)、蚜属种 (*Aphis* spp.) (例如绣线菊蚜 (*Aphis citricola*)、黑豆蚜 (*Aphis craccivora*)、甜菜蚜 (*Aphis fabae*)、*Aphis forbesi*、大豆蚜 (*Aphis glycines*)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)、常春藤蚜 (*Aphis hederæ*)、*Aphis illinoisensis*、中仲蚜 (*Aphis middletoni*)、鼠李马铃薯蚜 (*Aphis nasturtii*)、夹竹桃蚜 (*Aphis nerii*)、苹果蚜 (*Aphis pomi*)、绣线菊蚜 (*Aphis spiraeicola*)、喜荚蒾蚜 (*Aphis viburniphila*))、葡萄叶蜂 (*Arboridia apicalis*)、*Arytainilla*属种、小圆盾蚧属种 (*Aspidiella* spp.)、薄圆盾介壳虫属种 (*Aspidiotus* spp.) (例如常春藤圆盾蚧 (*Aspidiotus nerii*))、*Atanus*属种、茄沟无网蚜 (*Aulacorthum solani*)、烟粉虱 (*Bemisia tabaci*)、*Blastopsylla occidentalis*、*Boreioglycaspis melaleucae*、李短尾蚜 (*Brachycaudus helichrysi*)、*Brachycolus*属种、甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*)、喀目虱属种 (*Cacopsylla* spp.) (例如梨木虱 (*Cacopsylla pyricola*))、小褐稻虱 (*Calligypona marginata*)、*Capulinia*属种、黄头大叶蝉 (*Carneocephala fulgida*)、甘蔗绵蚜 (*Ceratovacuna lanigera*)、沫蝉科 (*Cercopidae*)、蜡蚧属种 (*Ceroplastes* spp.)、草莓钉蚜 (*Chaetosiphon fragaefolii*)、蔗黄雪盾蚧 (*Chionaspis tegalensis*)、茶绿叶蜂 (*Chlorita onukii*)、台湾大蝗 (*Chondracris rosea*)、核桃黑斑蚜 (*Chromaphis juglandicola*)、褐圆蚧 (*Chrysomphalus aonidum*)、黑褐圆盾蚧 (*Chrysomphalus ficus*)、玉米叶蝉 (*Cicadulina mbila*)、*Coccomytilus halli*、软蚧属种 (*Coccus* spp.) (例如褐软蚧 (*Coccus hesperidum*)、长椭圆软蚧 (*Coccus longulus*)、桔软蜡蚧 (*Coccus pseudomagnoliarum*)、咖啡绿蚧 (*Coccus viridis*))、隐瘤蚜 (*Cryptomyzus ribis*)、*Cryptoneossa*属种、蓝桉木属种 (*Ctenarytaina* spp.)、*Dalbulus*属

种、*Dialeurodes chittendeni*、柑橘粉虱(*Dialeurodes citri*)、柑橘木虱(*Diaphorina citri*)、白背盾蚧属种(*Diaspis* spp.)、双尾蚜属种(*Diuraphis* spp.)、草履介壳虫属种(*Drosicha* spp.)、西圆尾蚜属种(*Dysaphis* spp.) (例如芹叶西圆尾蚜(*Dysaphis apiifolia*)、车前圆尾蚜(*Dysaphis plantaginea*)、百合西圆尾蚜(*Dysaphis tulipae*))、灰粉蚧属种(*Dysmicoccus* spp.)、小绿叶蝉属种(*Empoasca* spp.) (例如西部马铃薯叶蝉(*Empoasca abrupta*)、蚕豆小绿叶蝉(*Empoasca fabae*)、苹果小绿叶蝉(*Empoasca maligna*)、茄小绿叶蝉(*Empoasca solana*)、*Empoasca stevensi*)、绵蚜属种(*Eriosoma* spp.) (例如美洲绵蚜(*Eriosoma americanum*)、苹果绵蚜(*Eriosoma lanigerum*)、居梨绵蚜(*Eriosoma pyricola*))、斑叶蝉属种(*Erythroneura* spp.)、*Eucalyptolyma*属种、褐木虱属种(*Euphyllura* spp.)、*Euscelis bilobatus*、拂粉阶属种(*Ferrisia* spp.)、围盾介壳虫属种、*Furcaspis oceanica*、咖啡地粉蚧(*Geococcus coffeae*)、*Glycaspis*属种、银合欢木虱(*Heteropsylla cubana*)、*Heteropsylla spinulosa*、假桃病毒叶蝉(*Homalodisca coagulata*)、桃大尾蚜(*Hyalopterus arundinis*)、李大尾蚜(*Hyalopterus pruni*)、吹绵蚧属种(*Icerya* spp.) (例如吹绵蚧(*Icerya purchasi*))、片角叶蝉属种(*Idiocerus* spp.)、扁喙叶蝉属种(*Idioscopus* spp.)、灰飞虱(*Laodelphax striatellus*)、蜡蚧属种(*Lecanium* spp.) (例如水土坚蚧(*Lecanium corni*) (= *Parthenolecanium corni*))、牡蛎蚧属种(*Lepidosaphes* spp.) (例如榆蛎盾蚧(*Lepidosaphes ulmi*))、萝卜蚜(*Lipaphis erysimi*)、长白盾蚧(*Lopholeucaspis japonica*)、斑衣蜡蝉(*Lycorma delicatula*)、长管蚜属种(*Macrosiphum* spp.) (例如马铃薯长管蚜(*Macrosiphum euphorbiae*)、百合长管蚜(*Macrosiphum lilii*)、蔷薇长管蚜(*Macrosiphum rosae*))、二点叶蜂(*Macrosteles facifrons*)、*Mahanarva*属种、高粱蚜(*Melanaphis sacchari*)、*Metcalfiella*属种、*Metcalfa pruinosa*、麦无网蚜(*Metopolophium dirhodum*)、黑缘平翅斑蚜(*Monellia costalis*)、*Monelliopsis pecanis*、瘤蚜属种(*Myzus* spp.) (例如冬葱瘤蚜(*Myzus ascalonicus*)、李瘤蚜(*Myzus cerasi*)、女贞瘤蚜(*Myzus ligustri*)、饰瘤蚜(*Myzus ornatus*)、桃蚜(*Myzus persicae*)、烟蚜(*Myzus nicotianae*))、莴苣衲长管蚜(*Nasonovia ribisnigri*)、新马氏粉虱属种(*Neomaskellia* spp.)、黑尾叶蝉属种(*Nephotettix* spp.) (例如黑尾叶蝉(*Nephotettix cincticeps*)、二条黑尾叶蝉(*Nephotettix nigropictus*))、*Nettigoniclla spectra*、褐飞虱(*Nilaparvata lugens*)、*Oncometopia*属种、*Orthezia praelonga*、中华稻蝗(*Oxya chinensis*)、*Pachypsylla*属种、杨梅粉虱(*Parabemisia myricae*)、虱啮属种(*Paratrioza* spp.) (例如马铃薯木虱(*Paratrioza cockerelli*))、片盾蚧属种(*Parlatoria* spp.)、瘿绵蚜属种(*Pemphigus* spp.) (例如囊柄瘿绵蚜(*Pemphigus bursarius*)、*Pemphigus populivenae*)、玉米蜡蝉(*Peregrinus maidis*)、扁角飞虱属种(*Perkinsiella* spp.)、绵粉蚧属种(*Phenacoccus* spp.) (例如苏铁褐点并盾蚧(*Phenacoccus madeirensis*))、杨平翅绵蚜(*Phloeomyzus passerinii*)、忽布疣蚜(*Phorodon humuli*)、葡萄根瘤蚜属种(*Phylloxera* spp.) (例如破倭蚜(*Phylloxera devastatrix*)、警倭蚜(*Phylloxera notabilis*))、苏铁褐点并盾蚧(*Pinnaspis aspidistrae*)、臀纹粉蚧属种(*Planococcus* spp.) (例如橘臀纹粉蚧(*Planococcus citri*))、*Prosopidopsylla flava*、梨形原绵腊蚧(*Protopulvinaria pyriformis*)、桑白盾蚧(*Pseudaulacaspis pentagona*)、粉蚧属种(*Pseudococcus* spp.) (例如嗜桔粉蚧

(*Pseudococcus calceolariae*)、康氏粉蚧(*Pseudococcus comstocki*)、长尾粉蚧(*Pseudococcus longispinus*)、真葡萄粉蚧(*Pseudococcus maritimus*)、暗色粉蚧(*Pseudococcus viburni*)、*Psyllopsis*属种、木虱属种(*Psylla* spp.) (例如黄杨木虱(*Psylla buxi*)、苹木虱(*Psylla mali*)、梨木虱(*Psylla pyri*)、金小蜂属种(*Pteromalus* spp.)、绵蜡蚧属种(*Pulvinaria* spp.)、*Pyrilla*属种、笠圆盾蚧属种(*Quadraspidiotus* spp.) (例如胡桃园盾蚧(*Quadraspidiotus juglansregiae*)、华笠圆盾蚧(*Quadraspidiotus ostreaeformis*)、梨笠盾蚧(*Quadraspidiotus perniciosus*))、*Quesada gigas*、平刺粉蚧属种(*Rastrococcus* spp.)、缢管蚜属种(*Rhopalosiphum* spp.) (例如玉米蚜(*Rhopalosiphum maidis*)、*Rhopalosiphum oxyacanthae*、禾谷缢管蚜(*Rhopalosiphum padi*)、红腹缢管蚜(*Rhopalosiphum rufiabdominale*))、黑盔蚧属种(*Saissetia* spp.) (例如咖啡珠蜡蚧(*Saissetia coffeae*)、*Saissetia miranda*、*Saissetia neglecta*、榄珠蜡蚧(*Saissetia oleae*))、葡萄带叶蝉(*Scaphoideus titanus*)、麦二叉蚜(*Schizaphis graminum*)、苏铁刺圆盾蚧(*Selenaspidus articulatus*)、麦长管蚜(*Sitobion avenae*)、长唇基飞虱属种(*Sogatata* spp.)、白背飞虱(*Sogatella furcifera*)、*Sogatodes*属种、*Stictocephala festina*、树粉虱(*Siphoninus phillyreae*)、*Tenalaphara malayensis*、*Tetragonocephala*属种、*Tinocallis caryaefoliae*、广胸沫蝉属种(*Tomaspis* spp.)、声蚜属种(*Toxoptera* spp.) (例如小桔蚜(*Toxoptera aurantii*)、大桔蚜(*Toxoptera citricidus*))、温室粉虱(*Trialeurodes vaporariorum*)、尖翅木虱属种(*Trioza* spp.) (例如柿木虱(*Trioza diospyri*))、小叶蝉属种(*Typhlocyba* spp.)、尖盾蚧属种(*Unaspis* spp.)、葡萄根瘤蚜(*Viteus vitifolii*)、么叶蝉属种(*Zygin* spp.)；

[0211] 来自异翅亚目(Heteroptera)的害虫,例如,麦蝽属种(*Aelia* spp.)、南瓜缘蝽(*Anasa tristis*)、拟丽蝽属种(*Antestiopsis* spp.)、*Boisea*属种、土长蝽属种(*Blissus* spp.)、俊盲蝽属种(*Calocoris* spp.)、微刺盲蝽属(*Campylomma livida*)、异背长蝽属种(*Cavelerius* spp.)、臭虫属种(*Cimex* spp.) (例如*Cimex adjunctus*、热带臭虫(*Cimex hemipterus*)、温带臭虫(*Cimex lectularius*)、蝠臭虫(*Cimex pilosellus*))、白瓣麦寄蝇属种(*Collaria* spp.)、*Creontiades dilutus*、胡椒缘蝽(*Dasynus piperis*)、*Dichelops furcatus*、厚氏长棒网蝽(*Diconocoris hewetti*)、棉红蝽属种(*Dysdercus* spp.)、美洲蝽属种(*Euschistus* spp.) (例如*Euschistus heros*、褐臭蝽(*Euschistus servus*)、三点蝽(*Euschistus tristigma*)、一点蝽(*Euschistus variolarius*))、菜蝽属种(*Eurydema* spp.)、扁盾蝽属种(*Eurygaster* spp.)、茶翅蝽(*Halyomorpha halys*)、*Heliopeltis*属种、*Horcias nobilellus*、稻缘蝽属种(*Leptocorisa* spp.)、稻缘蝽象(*Leptocorisa varicornis*)、*Leptoglossus occidentalis*、棉铃喙缘蝽(*Leptoglossus phyllopus*)、丽盲蝽属种(*Lygocoris* spp.) (例如原丽盲蝽(*Lygocoris pabulinus*))、草盲蝽属种(*Lygus* spp.) (例如*Lygus elisus*、豆莢草盲蝽(*Lygus hesperus*)、美国牧草盲蝽(*Lygus lineolaris*))、巨股长蝽属种(*Macropes excavatus*)、筛豆龟蝽(*Megacopta cribraria*)、盲蝽(*Miridae*)、黑摩盲蝽(*Monalonion atratum*)、绿蝽属种(*Nezara* spp.) (例如稻绿蝽(*Nezara viridula*))、小长蝽属种(*Nysius* spp.)、稻蝽属种(*Oebalus* spp.)、*Pentomidae*、方背皮蝽(*Piesma quadrata*)、壁蝽属种(*Piezodorus* spp.) (例如*Piezodorus*

guildinii)、盲蝽属种(*Psallus* spp.)、*Pseudacysta perseae*、红猎蝽属种(*Rhodnius* spp.)、可可褐盲蝽(*Sahlbergella singularis*)、*Scaptocoris castanea*、黑蝽属种(*Scotinophora* spp.)、梨冠网蝽(*Stephanitis nashi*)、*Tibraca*属种、锥猎蝽属种(*Triatoma* spp.)；

[0212] 来自膜翅目(Hymenoptera)的害虫,例如,顶切叶蚁属种(*Acromyrmex* spp.)、残青叶蜂属种(*Athalia* spp.) (例如*Athalia rosae*)、切叶蚁属种(*Atta* spp.)、弓背蚁属种(*Camponotus* spp.)、长黄胡蜂属种(*Dolichovespula* spp.)、松叶蜂属种(*Diprion* spp.) (例如类欧松叶蜂(*Diprion similis*))、实叶蜂属种(*Hoplocampa* spp.) (例如樱实叶蜂(*Hoplocampa cookei*)、苹叶蜂(*Hoplocampa testudinea*))、毛蚁属种(*Lasius* spp.)、阿根廷蚁(*Linepithema humile*)、小家蚁(*Monomorium pharaonis*)、立毛蚁属种(*Paratrechina* spp.)、*Paravespula*属种、斜结蚁属种(*Plagiolepis* spp.)、树蜂属种(*Sirex* spp.)、红火蚁(*Solenopsis invicta*)、臭蚁属种(*Tapinoma* spp.)、白足狡臭蚁(*Technomyrmex albipes*)、树蜂属种(*Urocerus* spp.)、胡蜂属种(*Vespa* spp.) (例如黄边胡蜂(*Vespa crabro*))、小火蚁(*Wasmannia auropunctata*)、黑树蜂属种(*Xeris* spp.)；

[0213] 来自等足目(Isopoda)的害虫,例如,鼠妇(*Armadillidium vulgare*)、栉水虱(*Oniscus asellus*)、球鼠妇(*Porcellio scaber*)；

[0214] 来自等翅目(Isoptera)的害虫,例如,家白蚁属种(*Coptotermes* spp.) (例如台湾乳白蚁(*Coptotermes formosanus*))、堆角白蚁(*Cornitermes cumulans*)、堆砂白蚁属种(*Cryptotermes* spp.)、楹白蚁属种(*Incisitermes* spp.)、木白蚁属种(*Kaloterme* spp.)、稻麦小白蚁(*Microtermes obesi*)、象白蚁属种(*Nasutitermes* spp.)、土白蚁属种(*Odontotermes* spp.)、盲白蚁属种(*Porotermes* spp.)、散白蚁属种(*Reticulitermes* spp.) (例如黄肢散白蚁(*Reticulitermes flavipes*)、西方散白蚁(*Reticulitermes hesperus*))；

[0215] 来自鳞翅目(Lepidoptera)的害虫,例如,小蜡螟(*Achroia grisella*)、桑剑纹夜蛾(*Acronicta major*)、褐带卷蛾属种(*Adoxophyes* spp.) (例如棉褐带卷蛾(*Adoxophyes orana*))、烦夜蛾(*Aedia leucomelas*)、地老虎属种(*Agrotis* spp.) (例如黄地老虎(*Agrotis segetum*)、小地老虎(*Agrotis ipsilon*))、波纹夜蛾属种(*Alabama* spp.) (例如棉叶波纹夜蛾(*Alabama argillacea*))、脐橙螟(*Amyelois transitella*)、条麦蛾属种(*Anarsia* spp.)、干煞夜蛾属种(*Anticarsia* spp.) (例如大豆夜蛾(*Anticarsia gemmatalis*))、条小卷蛾属种(*Argyroploce* spp.)、丫蚊夜蛾属种(*Autographa* spp.)、甘蓝夜蛾(*Barathra brassicae*)、苹髓尖蛾(*Blastodacna atra*)、籼弄蝶(*Borbo cinnara*)、棉潜蛾(*Bucculatrix thurberiella*)、松尺蠖(*Bupalus piniarius*)、蛀褐夜蛾属种(*Busseola* spp.)、卷叶蛾属种(*Cacoecia* spp.)、茶细蛾(*Caloptilia theivora*)、烟卷蛾(*Capua reticulana*)、苹果蠹蛾(*Carpocapsa pomonella*)、桃蛀果蛾(*Carposina niponensis*)、冬尺蛾(*Cheimatobia brumata*)、禾草螟属种(*Chilo* spp.) (例如*Chilo plejadellus*、二化螟(*Chilo suppressalis*))、*Choreutis pariana*、色卷蛾属种(*Choristoneura* spp.)、*Chrysodeixis chalcites*、葡萄果蠹蛾(*Clysia ambiguella*)、*Cnaphalocerus*属种、稻纵卷叶野螟(*Cnaphalocrocis medinalis*)、云卷蛾属种(*Cnephasia* spp.)、*Conopomorpha*属种、球颈象属种(*Conotrachelus* spp.)、*Copitarsia*属种、小卷蛾属

种(*Cydia* spp.) (例如豌豆小卷蛾(*Cydia nigricana*)、苹果蠹蛾(*Cydia pomonella*))、*Dalaca noctuides*、绢野螟属种(*Diaphania* spp.)、*Diparopsis*属种、小蔗杆草螟(*Diatraea saccharalis*)、钻夜蛾属种(*Earias* spp.)、*Ecdytolopha aurantium*、南美玉米苗斑螟(*Elasmopalpus lignosellus*)、甘薯杆螟(*Eldana saccharina*)、粉斑螟属种(*Ephestia* spp.) (例如烟草粉斑螟(*Ephestia elutella*)、地中海斑螟(*Ephestia kuehniella*))、叶小卷蛾属种(*Epinotia* spp.)、苹淡褐卷蛾(*Epiphyas postvittana*)、松尺蛾属种(*Erannis* spp.)、*Erschoviella musculana*、莢斑螟属种(*Etiella* spp.)、*Eudocima*属种、棕卷蛾属种(*Eulia* spp.)、女贞细卷蛾(*Eupoecilia ambiguella*)、毒蛾属种(*Euproctis* spp.) (例如黄毒蛾(*Euproctis chrysorrhoea*))、切夜蛾属种(*Euxoa* spp.)、脏切夜蛾属种(*Feltia* spp.)、大蜡螟(*Galleria mellonella*)、细蛾属种(*Gracillaria* spp.)、小食心虫属种(*Grapholitha* spp.) (例如梨小食心虫(*Grapholita molesta*)、杏小食心虫(*Grapholita prunivora*))、*Hedylepta*属种、铃夜蛾属种(*Helicoverpa* spp.) (例如棉铃虫(*Helicoverpa armigera*)、玉米夜蛾(*Helicoverpa zea*))、实夜蛾属种(*Heliothis* spp.) (例如烟芽夜蛾(*Heliothis virescens*))、褐织蛾(*Hofmannophila pseudospretella*)、同斑螟属种(*Homoeosoma* spp.)、长卷蛾属种(*Homona* spp.)、苹果巢蛾(*Hyponomeuta padella*)、柿举枝蛾(*Kakivoria flavofasciata*)、亮灰蝶属种(*Lampides* spp.)、贪夜蛾属种(*Laphygma* spp.)、梨小食心虫(*Laspeyresia molesta*)、茄白翅野螟(*Leucinodes orbonalis*)、纹潜蛾属种(*Leucoptera* spp.) (例如咖啡潜叶蛾(*Leucoptera coffeella*))、潜叶细蛾属种(*Lithocolletis* spp.) (例如苹果斑幕潜叶蛾(*Lithocolletis blancardella*))、绿果冬夜蛾(*Lithophane antennata*)、花翅小蛾属种(*Lobesia* spp.) (例如葡萄花翅小卷蛾(*Lobesia botrana*))、豆白隆切根虫(*Loxagrotis albicosta*)、毒蛾属种(*Lymantria* spp.) (例如舞毒蛾(*Lymantria dispar*))、潜蛾属种(*Lyonetia* spp.) (例如桃潜叶蛾(*Lyonetia clerkella*))、黄褐天幕毛虫(*Malacosoma neustria*)、豆莢野螟(*Maruca testulalis*)、甘蓝夜蛾(*Mamestra brassicae*)、暮眼蝶(*Melanitis leda*)、毛胫夜蛾属种(*Mocis* spp.)、*Monopis obviella*、粘虫(*Mythimna separata*)、橡长角蛾(*Nemapogon cloacellus*)、水螟属种(*Nymphula* spp.)、*Oiketicus*属种、正甘薯茎螟属种(*Omphisa* spp.)、秋尺蛾属种(*Operophtera* spp.)、麦茎夜蛾属种(*Oria* spp.)、瘤丛螟属种(*Orthaga* spp.)、茎野螟属种(*Ostrinia* spp.) (例如欧洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis*))、黑角负泥虫(*Oulema melanopus*)、水稻负泥虫(*Oulema oryzae*)、小眼夜蛾(*Panolis flammea*)、稻弄蝶属种(*Parnara* spp.)、红铃虫属种(*Pectinophora* spp.) (例如棉红铃虫(*Pectinophora gossypiella*))、潜跳甲属种(*Perileucoptera* spp.)、茄麦蛾属种(*Phthorimaea* spp.) (例如马铃薯麦蛾(*Phthorimaea operculella*))、桔潜蛾(*Phyllocnistis citrella*)、小潜细蛾属种(*Phyllonorycter* spp.) (例如金纹小潜细蛾(*Phyllonorycter blancardella*)、山楂潜叶蛾(*Phyllonorycter crataegella*))、粉蝶属种(*Pieris* spp.) (例如菜粉蝶(*Pieris rapae*))、荷兰石竹小卷蛾(*Platynota stultana*)、印度谷斑螟(*Plodia interpunctella*)、金翅夜蛾属种(*Plusia* spp.)、菜蛾(*Plutella xylostella*) (= *Plutella maculipennis*)、小白巢蛾属种(*Prays* spp.)、斜纹夜蛾属种(*Prodenia* spp.)、烟草天蛾属种(*Protoparce* spp.)、粘虫属种(*Pseudaletia* spp.) (例如一星粘虫(*Pseudaletia unipuncta*))、大豆尺夜蛾

(*Pseudoplusia includens*)、玉米螟(*Pyrausta nubilalis*)、*Rachiplusia nu*、禾螟属种(*Schoenobius* spp.) (例如*Schoenobius bipunctifer*)、白禾螟属种(*Scirpophaga* spp.) (例如稻白螟(*Scirpophaga innotata*))、黄地老虎(*Scotia segetum*)、蛀茎夜蛾属种(*Sesamia* spp.) (例如大螟(*Sesamia inferens*))、长须卷蛾属种(*Sparganothis* spp.)、灰翅夜蛾属种(*Spodoptera* spp.) (例如*Spodoptera eradiana*、甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua*)、草地夜蛾(*Spodoptera frugiperda*)、*Spodoptera praefica*)、展足蛾属种(*Stathmopoda* spp.)、*Stenoma*属种、花生麦蛾(*Stomopteryx subsecivella*)、透翅蛾属种(*Synanthedon* spp.)、安第斯马铃薯块茎蛾(*Tecia solanivora*)、异舟蛾属种(*Thaumetopoea* spp.)、大豆夜蛾(*Thermesia gemmatilis*)、木塞谷蛾(*Tinea cloacella*)、袋谷蛾(*Tinea pellionella*)、幕谷蛾(*Tineola bisselliella*)、卷蛾属种(*Tortrix* spp.)、毛毡衣蛾(*Trichophaga tapetzella*)、粉夜蛾属种(*Trichoplusia* spp.) (例如粉纹夜蛾(*Trichoplusia ni*))、三化螟(*Tryporyza incertulas*)、番茄斑潜蝇(*Tuta absoluta*)、灰蝶属种(*Virachola* spp.)；

[0216] 来自直翅目(Orthoptera)或跳跃目(Saltatoria)的害虫,例如,家蟋蟀(*Acheta domesticus*)、*Dichroplus*属种、蝼蛄属种(*Gryllotalpa* spp.) (例如欧洲蝼蛄(*Gryllotalpa gryllotalpa*))、蔗蝗属种(*Hieroglyphus* spp.)、飞蝗属种(*Locusta* spp.) (例如飞蝗(*Locusta migratoria*))、黑蝗属种(*Melanoplus* spp.) (例如*Melanoplus devastator*)、*Paratlanticus ussuriensis*、沙漠蝗(*Schistocerca gregaria*)；

[0217] 来自虱目(Phthiraptera)的害虫,例如,畜虱属种(*Damalinia* spp.)、血虱属种(*Haematopinus* spp.)、毛虱属种(*Linognathus* spp.)、虱属种(*Pediculus* spp.)、葡萄根瘤蚜(*Phylloxera vastatrix*)、阴虱(*Pthirus pubis*)、啮毛虱属种(*Trichodectes* spp.)；

[0218] 来自啮虫目(Psocoptera)的害虫,例如,*Lepinatus*属种、书虱属种(*Liposcelis* spp.)；

[0219] 来自蚤目(Siphonaptera)的害虫,例如,角叶蚤属种(*Ceratophyllus* spp.)、栉首蚤属种(*Ctenocephalides* spp.) (例如犬栉头蚤(*Ctenocephalides canis*),猫栉头蚤(*Ctenocephalides felis*))、扰蚤(*Pulex irritans*)、穿皮潜蚤(*Tunga penetrans*)、印鼠客蚤(*Xenopsylla cheopis*)；

[0220] 来自缨翅目(Thysanoptera)的害虫,例如,玉米黄呆蓟马(*Anaphothrips obscurus*)、稻蓟马(*Baliothrips biformis*)、*Chaetanaphothrips leeuweni*、葡萄镰蓟马(*Drepanothrips reuteri*)、*Enneothrips flavens*、花蓟马属种(*Frankliniella* spp.) (例如烟褐蓟马(*Frankliniella fusca*)、西花蓟马(*Frankliniella occidentalis*)、苏花蓟马(*Frankliniella schultzei*)、东方花蓟马(*Frankliniella tritici*)、*Frankliniella vaccinii*、威廉期花蓟马(*Frankliniella williamsi*))、简管蓟马属种(*Haplothrips* spp.)、阳蓟马属种(*Heliothrips* spp.)、温室条篱蓟马(*Hercinothrips femoralis*)、葡萄蓟马(*Rhipiphorothrips cruentatus*)、硬蓟马属种(*Scirtothrips* spp.)、*Taeniothrips cardamoni*、蓟马属种(*Thrips* spp.) (例如棕榈蓟马(*Thrips palmi*)、烟蓟马(*Thrips tabaci*))；

[0221] 来自衣鱼目(Zygentoma)(=缨尾亚目(Thysanura))的害虫,例如,栉衣鱼属种(*Ctenolepisma* spp.)、蠹鱼(*Lepisma saccharina*)、衣鱼(*Lepismodes inquilinus*)、家衣

鱼 (*Thermobia domestica*) ;

[0222] 来自综合纲 (Symphyla) 的害虫, 例如, 么蚰属种 (*Scutigereella* spp.) (例如无斑点么蚰 (*Scutigereella immaculata*)) ;

[0223] 来自软体动物门 (Mollusca) 的害虫, 特别是来自双壳纲 (*Bivalvia*) 的害虫, 如饰贝属种 (*Dreissena* spp.) ,

[0224] 以及来自腹足纲 (*Gastropoda*) 的害虫, 例如阿勇蛞蝓属种 (*Arion* spp.) (例如黑红阿勇蛞蝓 (*Arion ater rufus*))、双脐螺属种 (*Biomphalaria* spp.)、小泡螺属种 (*Bulinus* spp.)、野蛞蝓属种 (*Deroceras* spp.) (例如田灰蛞蝓 (*Deroceras laeve*))、土蜗属种 (*Galba* spp.)、椎实螺属种 (*Lymnaea* spp.)、钉螺属种 (*Oncomelania* spp.)、福寿螺属种 (*Pomacea* spp.)、琥珀螺属种 (*Succinea* spp.) ;

[0225] 来自扁形动物门 (Plathelminthes) 和线虫动物门 (Nematoda) 的动物和人体寄生虫, 例如猫圆线虫属种 (*Aelurostrongylus* spp.)、裂口线虫属种 (*Amidostomum* spp.)、钩口线虫属种 (*Ancylostoma* spp.)、血管圆线虫属种 (*Angiostrongylus* spp.)、异尖线虫属种 (*Anisakis* spp.)、裸头绦虫属种 (*Anoplocephala* spp.)、蛔虫属种 (*Ascaris* spp.)、鸡蛔虫属种 (*Ascaridia* spp.)、贝利蛔虫属种 (*Baylisascaris* spp.)、布鲁格氏丝虫属种 (*Brugia* spp.)、仰口线虫属种 (*Bunostomum* spp.)、毛细线虫属种 (*Capillaria* spp.)、夏氏线虫属种 (*Chabertia* spp.)、支睾吸虫属种 (*Clonorchis* spp.)、古柏线虫属种 (*Cooperia* spp.)、环体线虫属种 (*Crenosoma* spp.)、杯口线虫属种 (*Cyathostoma* spp.)、双腔吸虫属种 (*Dicrocoelium* spp.)、网尾线虫属种 (*Dictyocaulus* spp.)、裂头绦虫属种 (*Diphyllbothrium* spp.)、复孔绦虫属种 (*Dipylidium* spp.)、恶丝虫属种 (*Dirofilaria* spp.)、龙线虫属种 (*Dracunculus* spp.)、棘球绦虫属种 (*Echinococcus* spp.)、棘口吸虫属种 (*Echinostoma* spp.)、蛲虫属种 (*Enterobius* spp.)、真鞘线虫属种 (*Eucoleus* spp.)、片形吸虫属种 (*Fasciola* spp.)、拟片吸虫属种 (*Fascioloides* spp.)、姜片虫属种 (*Fasciolopsis* spp.)、类丝线虫属种 (*Filaroides* spp.)、筒线虫属种 (*Gongylonema* spp.)、三代虫属种 (*Gyrodactylus* spp.)、丽线虫属种 (*Habronema* spp.)、血矛线虫属种 (*Haemonchus* spp.)、螺旋线虫属种 (*Heligmosomoides* spp.)、异刺线虫属种 (*Heterakis* spp.)、膜壳绦虫属种 (*Hymenolepis* spp.)、猪圆线虫属种 (*Hyostromylus* spp.)、光丝虫属种 (*Litomosoides* spp.)、罗阿丝虫属种 (*Loa* spp.)、后圆线虫属种 (*Metastrongylus* spp.)、次睾吸虫属种 (*Metorchis* spp.)、中殖孔绦虫属种 (*Mesocetoides* spp.)、蒙尼茨绦虫属种 (*Moniezia* spp.)、缪勒线虫属种 (*Muellerius* spp.)、板口线虫属种 (*Necator* spp.)、细颈线虫属种 (*Nematodirus* spp.)、日圆线虫属种 (*Nippostrongylus* spp.)、结节线虫属种 (*Oesophagostomum* spp.)、盘头线虫属种 (*Ollulanus* spp.)、盘尾丝虫属种 (*Onchocerca* spp.)、后睾吸虫属种 (*Opisthorchis* spp.)、奥斯勒丝虫属种 (*Oslerus* spp.)、奥斯特线虫属种 (*Ostertagia* spp.)、尖尾线虫属种 (*Oxyuris* spp.)、*Paracapillaria* 属种、副丝虫属种 (*Parafilaria* spp.)、并殖吸虫属种 (*Paragonimus* spp.)、同盘吸虫属种 (*Paramphistomum* spp.)、副裸头绦虫属种 (*Paranoplocephala* spp.)、副蛔虫属种 (*Parascaris* spp.)、栓尾线虫属种 (*Passalurus* spp.)、原圆线虫属种 (*Protostrongylus* spp.)、裂体吸虫属种 (*Schistosoma* spp.)、腹腔丝虫属种 (*Setaria* spp.)、旋毛线虫属种 (*Spirocerca* spp.)、冠丝虫属种 (*Stephanofilaria* spp.)、冠尾线虫

属种(*Stephanurus* spp.)、类圆线虫属种(*Strongyloides* spp.)、圆线虫属种(*Strongylus* spp.)、比翼线虫属种(*Syngamus* spp.)、绦虫属种(*Taenia* spp.)、背带线虫属种(*Teladorsagia* spp.)、吸吮线虫属种(*Thelazia* spp.)、弓蛔线虫属种(*Toxascaris* spp.)、弓蛔虫属种(*Toxocara* spp.)、毛线虫属种(*Trichinella* spp.)、毛血吸虫属种(*Trichobilharzia* spp.)、毛圆线虫属种(*Trichostrongylus* spp.)、鞭虫属种(*Trichuris* spp.)、钩虫属种(*Uncinaria* spp.)、吴策线虫属种(*Wuchereria* spp.)；

[0226] 来自线虫动物门(Nematoda)的植物害虫,即植物寄生性线虫,尤其是野外垫刃线虫属种(*Aglenchus* spp.) (例如居农野外垫刃线虫(*Aglenchus agricola*))、粒线虫属种(*Anguina* spp.) (例如小麦粒线虫(*Anguina tritici*))、滑刃线虫属种(*Aphelenchoides* spp.) (例如花生滑刃线虫(*Aphelenchoides arachidis*)、草莓滑刃线虫(*Aphelenchoides fragariae*))、刺线虫属种(*Belonolaimus* spp.) (例如细小刺线虫(*Belonolaimus gracilis*)、长尾刺线虫(*Belonolaimus longicaudatus*)、诺顿刺线虫(*Belonolaimus nortoni*))、伞滑刃线虫属种(*Bursaphelenchus* spp.) (例如椰子红环腐线虫(*Bursaphelenchus cocophilus*)、荒漠伞滑刃线虫(*Bursaphelenchus eremus*)、松材线虫(*Bursaphelenchus xylophilus*))、坏死线虫属种(*Cacopaurus* spp.) (例如有害坏死线虫(*Cacopaurus pestis*))、小环线虫属种(*Criconemella* spp.) (例如弯曲小环线虫(*Criconemella curvata*)、*Criconemella onoensis*、装饰小环线虫(*Criconemella ornata*)、*Criconemella rusium*、薄叶小环线虫(*Criconemella xenoplax*(=环腐线虫(*Mesocriconema xenoplax*))))、小环线虫属种(*Criconemoides* spp.) (例如*Criconemoides ferniae*、*Criconemoides onoense*、*Criconemoides ornatum*)、双垫刃属种(*Ditylenchus* spp.) (例如鳞球茎茎线虫(*Ditylenchus dipsaci*))、锥线虫属种(*Dolichodorus* spp.)、球异皮线虫属种(*Globodera* spp.) (例如马铃薯白线虫(*Globodera pallida*)、马铃薯金线虫(*Globodera rostochiensis*))、螺旋线虫属种(*Helicotylenchus* spp.) (例如双宫螺旋线虫(*Helicotylenchus dihystera*))、半轮线虫属种(*Hemicriconemoides* spp.)、鞘线虫属种(*Hemicyclophora* spp.)、异皮线虫属种(*Heterodera* spp.) (例如燕麦异皮胞囊线虫(*Heterodera avenae*)、大豆胞囊线虫(*Heterodera glycines*)、甜菜胞囊线虫(*Heterodera schachtii*))、纽带线虫属种(*Hoplolaimus* spp.)、长针线虫属种(*Longidorus* spp.) (例如非洲长针线虫(*Longidorus africanus*))、根结线虫属种(*Meloidogyne* spp.) (例如哥伦比亚根结线虫(*Meloidogyne chitwoodi*)、*Meloidogyne fallax*、北方根结线虫(*Meloidogyne hapla*)、南方根结线虫(*Meloidogyne incognita*))、*Meloinema*属种、珍珠线虫属种(*Nacobbus* spp.)、拟茎线虫属种(*Neotylenchus* spp.)、拟长针线虫属种(*Paralongidorus* spp.)、拟滑刃线虫属种(*Paraphelenchus* spp.)、拟毛刺线虫属种(*Paratrichodorus* spp.) (例如微小拟毛刺线虫(*Paratrichodorus minor*))、短体线虫属种(*Pratylenchus* spp.) (例如穿刺短体线虫(*Pratylenchus penetrans*))、*Pseudohalenchus*属种、平滑垫刃属种(*Psilenchus* spp.)、斑皮线虫属种(*Punctodera* spp.)、五沟线虫属种(*Quinisulcius* spp.)、穿孔线虫属种(*Radopholus* spp.) (例如柑桔穿孔线虫(*Radopholus citrophilus*)、香蕉穿孔线虫(*Radopholus similis*))、肾状线虫属种(*Rotylenchulus* spp.)、盘旋线虫属种(*Rotylenchus* spp.)、盾线虫属种(*Scutellonema* spp.)、亚粒线虫属种(*Subanguina*

spp.)、毛刺线虫属种(*Trichodorus* spp.) (例如钝毛刺线虫(*Trichodorus obtusus*)、原始毛刺线虫(*Trichodorus primitivus*))、垫刃线虫属种(*Tylenchulus* spp.)、矮化线虫属种(*Tylenchorhynchus* spp.) (例如饰环矮化线虫(*Tylenchorhynchus annulatus*))、垫刃线虫(*Tylenchulus* spp.) (例如柑桔根线虫(*Tylenchulus semipenetrans*))、剑线虫属种(*Xiphinema* spp.) (例如标记剑线虫(*Xiphinema index*))。

[0227] 此外,还可防治来自原生动物(Protozoa)亚门、球虫目(Coccidia)的害虫,例如艾美球虫属种(*Eimeria* spp.)。

[0228] 线虫

[0229] 在本发明的上下文中,术语“线虫”包括线虫门的所有物种,且在本文中特别是植物或真菌上作为寄生虫的物种(例如滑刃目(*Aphelenchida*)、根结线虫、垫刃目(*Tylenchida*)的物种及其他物种)上,或者在人体和动物上作为寄生虫的物种(例如毛线虫目(*Trichinellida*)、垫刃目、小杆目(*Rhabditida*)和旋尾目(*Spirurida*)的物种),或者在这些活的生物体内或生物体上造成侵害的物种,以及其它寄生蠕虫。

[0230] 如本文中所述,作物保护中的杀线虫剂能够防治线虫。

[0231] 术语“防治线虫”意指杀死线虫或者预防或阻止它们的发育或它们的生长,或者预防或阻止它们侵入植物组织中或它们吸食植物组织。

[0232] 在本文中,化合物的功效通过下列方法来测定:将用式(I)的化合物处理的植物或植物部位或者经处理的土壤与未处理的植物或植物部位或者未经处理的土壤(100%)之间的死亡率、虫瘿形成、胞囊形成、每体积土壤的线虫密度、每株根的线虫密度、每体积土壤的线虫卵数、线虫的运动性进行比较。优选地,相对于未经处理的植物、植物部位或未经处理的土壤,所实现的减少为25-50%、更优选为51-79%且最优选减少80至100%,从而实现完全杀死线虫或完全预防线虫的发育和生长。本文所述的线虫防治还包括防治线虫的繁殖(胞囊和/或卵的发育)。式(I)的化合物还可以用于维持植物或动物的健康,并且它们可以用于治疗性、预防性或全身性地防治线虫。

[0233] 本领域技术人员知晓测定死亡率、虫瘿形成、胞囊形成、每体积土壤的线虫密度、每株根的线虫密度、每体积土壤的线虫卵数、线虫的运动性的方法。

[0234] 使用式(I)的化合物可保持植物健康并且还包括减少由线虫引起的侵害和提高采收产量。

[0235] 在本发明的上下文中,术语“线虫”是指植物线虫,其包括侵害植物的所有线虫。植物线虫包括植物寄生线虫和土传线虫。植物寄生线虫包括外寄生虫,例如剑线虫属种(*Xiphinema* spp.)、长针线虫属种(*Longidorus* spp.)和毛刺线虫属种(*Trichodorus* spp.);半寄生虫,例如半穿刺线虫属种(*Tylenchulus* spp.);移栖的内寄生虫,例如短体线虫属种(*Pratylenchus* spp.)、穿孔线虫属种(*Radopholus* spp.)和盾线虫属种(*Scutellonema* spp.);非移栖的寄生虫,例如异皮线虫属种(*Heterodera* spp.)、球异皮线虫属种(*Globodera* spp.)和根结线虫属种(*Meloidogyne* spp.);以及茎和叶的内寄生虫,例如双垫刃属种(*Ditylenchus* spp.)、滑刃线虫属种(*Aphelenchoides* spp.)和潜根线虫属种(*Hirschmaniella* spp.)。特别有害的寄生在根部的土壤线虫为,例如,异皮线虫属种或球形球异皮线虫属种的胞囊形成的线虫,和/或根结线虫属种的根瘿线虫。这些属种的有害物种为,例如,南方根结线虫(*Meloidogyne incognita*)、大豆异皮线虫(*Heterodera*

glycines) (大豆胞囊线虫)、马铃薯白线虫 (*Globodera pallida*) 和马铃薯金线虫 (*Globodera rostochiensis*) (黄色马铃薯胞囊线虫), 这些物种通过本文所述的化合物进行有效地防治。然而, 本文所述的化合物的用途绝不限于这些属种或物种, 而是以相同的方式延伸至其它线虫。

[0236] 植物线虫包括, 例如, 居农野外垫刃线虫 (*Aglenchus agricola*); 小麦粒线虫 (*Anguina tritici*); 花生滑刃线虫 (*Aphelenchoides arachidis*)、草莓滑刃线虫 (*Aphelenchoides fragariae*) 以及滑刃线虫属种 (*Aphelenchoides* spp.) 的茎和叶的内寄生虫; 细小刺线虫 (*Belonolaimus gracilis*)、长尾刺线虫 (*Belonolaimus longicaudatus*)、诺顿刺线虫 (*Belonolaimus nortoni*); 椰子红环腐线虫 (*Bursaphelenchus cocophilus*)、荒漠伞滑刃线虫 (*Bursaphelenchus eremus*)、松材线虫 (*Bursaphelenchus xylophilus*) 以及伞滑刃线虫属种 (*Bursaphelenchus* spp.); 有害坏死线虫 (*Cacopaurus pestis*); 弯曲小环线虫 (*Criconemella curvata*)、*Criconemella onoensis*、装饰小环线虫 (*Criconemella ornata*)、*Criconemella rusium*、薄叶小环线虫 (*Criconemella xenoplax*) (= 环腐线虫 (*Mesocriconema xenoplax*)) 以及小环线虫属种 (*Criconemella* spp.),

[0237] *Criconemoides ferniae*、*Criconemoides onoense*、*Criconemoides ornatum* 以及小环线虫属种 (*Criconemoides* spp.); 腐烂茎线虫 (*Ditylenchus destructor*)、鳞球茎茎线虫 (*Ditylenchus dipsaci*)、食菌茎线虫 (*Ditylenchus myceliophagus*) 以及双垫刃属种 (*Ditylenchus* spp.) 的茎和叶的内寄生虫; 异头锥线虫 (*Dolichodorus heterocephalus*); 马铃薯白线虫 (*Globodera pallida*) (= 马铃薯胞囊线虫 (*Heterodera pallida*))、马铃薯金线虫 (*Globodera rostochiensis*) (黄色马铃薯胞囊线虫 (yellow potato cyst nematode))、*Globodera solanacearum*、烟草胞囊线虫 (*Globodera tabacum*)、佛吉亚球胞囊线虫 (*Globodera virginii*) 以及异皮线虫属种 (*Globodera* spp.) 的非移栖的胞囊形成的寄生虫; 双角螺旋线虫 (*Helicotylenchus digonicus*)、双宫螺旋线虫 (*Helicotylenchus dihystra*)、刺桐双角螺旋线虫 (*Helicotylenchus erythrini*)、香蕉螺旋线虫 (*Helicotylenchus multicinctus*)、短小双角螺旋线虫 (*Helicotylenchus nannus*)、壮螺旋线虫 (*Helicotylenchus pseudorobustus*) 以及螺旋线虫属种 (*Helicotylenchus* spp.); 半小环线虫 (*Hemicriconemoides*); 蚤缀鞘线虫 (*Hemicycliophora arenaria*)、*Hemicycliophora nudata*、微细鞘线虫 (*Hemicycliophora parvana*)、燕麦异皮线虫 (*Heterodera avenae*)、十字花科异皮线虫 (*Heterodera cruciferae*)、大豆异皮线虫 (*Heterodera glycines*) (大豆胞囊线虫)、水稻异皮线虫 (*Heterodera oryzae*)、甜菜异皮线虫 (*Heterodera schachtii*)、玉米异皮线虫 (*Heterodera zeae*) 和异皮线虫属种的非移栖的胞囊形成的寄生虫; 纤细潜根线虫 (*Hirschmaniella gracilis*)、水稻潜根线虫 (*Hirschmaniella oryzae*)、棘尾赫希曼线虫 (*Hirschmaniella spinicaudata*) 和潜根线虫属种 (*Hirschmaniella* spp.) 的茎和叶的内寄生虫; 埃及纽带线虫 (*Hoplolaimus aegyptii*)、*Hoplolaimus californicus*、哥伦比亚纽带线虫 (*Hoplolaimus columbus*)、帽状纽带线虫 (*Hoplolaimus galeatus*)、印度纽带线虫 (*Hoplolaimus indicus*)、大针纽带线虫 (*Hoplolaimus magnistylus*)、不强纽带线虫 (*Hoplolaimus pararobustus*)、非洲长针线虫 (*Longidorus africanus*)、短环长针线虫 (*Longidorus breviannulatus*)、延伸长针线虫

(*Longidorus elongatus*)、光头长针线虫(*Longidorus laevicapitatus*)、藤蔓长针线虫(*Longidorus vineacola*)和长针线虫属种的外寄生虫;高粱根结线虫(*Meloidogyne acronea*)、非洲根结线虫(*Meloidogyne africana*)、花生根结线虫(*Meloidogyne arenaria*)、*Meloidogyne arenaria thamesi*、甘兰根结线虫(*Meloidogyne artiella*)、奇氏根结线虫(*Meloidogyne chitwoodi*)、*Meloidogyne coffeicola*、埃塞俄比亚根结线虫(*Meloidogyne ethiopica*)、短小根结线虫(*Meloidogyne exigua*)、大叶含笑根结线虫(*Meloidogyne fallax*)、禾草根结线虫(*Meloidogyne graminicola*)、禾本科根结线虫(*Meloidogyne graminis*)、北方根结线虫(*Meloidogyne hapla*)、南方根结线虫(*Meloidogyne incognita*)、原生南方根结线虫(*Meloidogyne incognita acrita*)、爪哇根结线虫(*Meloidogyne javanica*)、吉库尤根结线虫(*Meloidogyne kikuyensis*)、微小根结线虫(*Meloidogyne minor*)、纳西根结线虫(*Meloidogyne naasi*)、巴拉那根结线虫(*Meloidogyne paranaensis*)、泰晤士根结线虫(*Meloidogyne thamesi*)和根结线虫属的非移栖的寄生虫;瓢线虫属种(*Meloinema* spp.)、异常科布线虫(*Nacobbus aberrans*)、*Neotylenchus vigissi*、*Paraphelenchus pseudoparietinus*、葱拟毛刺线虫(*Paratrichodorus allius*)、裂片拟毛刺线虫(*Paratrichodorus lobatus*)、微小拟毛刺线虫(*Paratrichodorus minor*)、矮小拟毛刺线虫(*Paratrichodorus nanus*)、胼胝拟毛刺线虫(*Paratrichodorus porosus*)、光滑拟毛刺线虫(*Paratrichodorus teres*)和拟毛刺线虫属种(*Paratrichodorus* spp.);钩针线虫(*Paratylenchus hamatus*)、不显著针线虫(*Paratylenchus minutus*)、突出针线虫(*Paratylenchus projectus*)和针线虫属种(*Paratylenchus* spp.);敏捷短体线虫(*Pratylenchus agilis*)、艾氏短体线虫(*Pratylenchus alleni*)、安第斯短体线虫(*Pratylenchus andinus*)、最短尾短体线虫(*Pratylenchus brachyurus*)、谷类短体线虫(*Pratylenchus cerealis*)、咖啡短体线虫(*Pratylenchus coffeae*)、刻痕短体线虫(*Pratylenchus crenatus*)、德式短体线虫(*Pratylenchus delattrei*)、圆尾短体线虫(*Pratylenchus giibbicaudatus*)、古氏短体线虫(*Pratylenchus goodeyi*)、钩状短体线虫(*Pratylenchus hamatus*)、六纹短体线虫(*Pratylenchus hexincisus*)、卢斯短体线虫(*Pratylenchus loosi*)、落选短体线虫(*Pratylenchus neglectus*)、穿刺短体线虫(*Pratylenchus penetrans*)、草地短体线虫(*Pratylenchus pratensis*)、斯氏短体线虫(*Pratylenchus scribneri*)、精美短体线虫(*Pratylenchus teres*)、索氏短体线虫(*Pratylenchus thornei*)、伤残短体线虫(*Pratylenchus vulnus*)、玉米短体线虫(*Pratylenchus zeae*)和短体线虫属种的移栖的内寄生虫;*Pseudohalenchus minutus*、大齿平滑垫刃线虫(*Psilenchus magnidens*)、肿大平滑垫刃线虫(*Psilenchus tumidus*)、查尔斑皮线(*Punctodera chaltoensis*)、尖锐五沟线虫(*Quinisulcius acutus*)、柑橘穿孔线虫(*Radopholus citrophilus*)、相似穿孔线虫(*Radopholus similis*)、穿孔线虫属种的移栖的内寄生虫;北方肾型线虫(*Rotylenchulus borealis*)、微小肾型线虫(*Rotylenchulus parvus*)、肾形小环线虫(*Rotylenchulus reniformis*)和肾型线虫属种(*Rotylenchulus* spp.);直沟盘旋线虫(*Rotylenchus laurentinus*)、*Rotylenchus macrodoratus*、强壮盘旋线虫(*Rotylenchus robustus*)、单型盘旋线虫(*Rotylenchus uniformis*)和盘旋线虫属种(*Rotylenchus* spp.);小尾盾线虫(*Scutellonema brachyurum*)、缓慢盾线虫(*Scutellonema bradys*)、格尾盾线虫

(*Scutellonema clathricaudatum*) 和盾线虫属种 (*Scutellonema* spp.) 的移栖的内寄生虫;根癭亚线虫 (*Subanguina radiciola*)、*Titylenchus nicotianae*、圆筒毛刺线虫 (*Trichodorus cylindricus*)、微小毛刺线虫 (*Trichodorus minor*)、原始毛刺线虫 (*Trichodorus primitivus*)、邻近毛刺线虫 (*Trichodorus proximus*)、相似毛刺线虫 (*Trichodorus similis*)、少见毛刺线虫 (*Trichodorus sparsus*) 和毛刺线虫属种的外寄生虫;农田矮化线虫 (*Tylenchorhynchus agri*)、菜蔬矮化线虫 (*Tylenchorhynchus brassicae*)、清亮矮化线虫 (*Tylenchorhynchus clarus*)、克莱顿矮化线虫 (*Tylenchorhynchus claytoni*)、指状矮化线虫 (*Tylenchorhynchus digitatus*)、伊布里矮化线虫 (*Tylenchorhynchus ebriensis*)、最大矮化线虫 (*Tylenchorhynchus maximus*)、裸矮化线虫 (*Tylenchorhynchus nudus*)、普通矮化线虫 (*Tylenchorhynchus vulgaris*) 和矮化线虫属种 (*Tylenchorhynchus* spp.);柑桔根线虫 (*Tylenchulus semipenetrans*) 和小垫刃线虫属种的半寄生虫;美洲剑线虫 (*Xiphinema americanum*)、短颈剑线虫 (*Xiphinema brevicolle*)、*Xiphinema dimorphicaudatum*、标记剑线虫 (*Xiphinema index*) 和剑线虫属种 (*Xiphinema* spp.) 的外寄生虫。

[0238] 可使用式 (I) 的化合物来防治的线虫包括:根结线虫属的线虫,例如南方根结线虫 (*Meloidogyne incognita*)、爪哇根结线虫 (*Meloidogyne javanica*)、北方根结线虫 (*Meloidogyne hapla*) 和花生根结线虫 (*Meloidogyne arenaria*);茎线虫属的线虫,例如马铃薯腐烂线虫 (马铃薯茎线虫 (*Ditylenchus destructor*)) 以及茎和球茎线虫 (鳞球茎茎线虫 (*Ditylenchus dipsaci*));短体线虫 (*Pratylenchus*) 属的线虫,如玉米根腐线虫 (穿刺短体线虫 (*Pratylenchus penetrans*))、菊花根腐线虫 (伪短体线虫 (*Pratylenchus fallax*))、咖啡根腐线虫 (咖啡短体线虫 (*Pratylenchus coffeae*))、茶树根腐线虫 (卢斯短体线虫 (*Pratylenchus loosi*)) 和胡桃根腐线虫 (伤残短体线虫 (*Pratylenchus vulnus*));球异皮线虫属 (*Globodera*) 的线虫,如黄色马铃薯胞囊线虫 (马铃薯金线虫 (*Globodera rostochiensis*)) 和白色马铃薯胞囊线虫 (马铃薯白线虫 (*Globodera pallida*));异皮线虫属 (*Heterodera*) 的线虫,如大豆胞囊线虫 (大豆异皮线虫 (*Heterodera glycines*)) 和甜菜胞囊线虫 (甜菜异皮线虫 (*Heterodera schachtii*));滑刃线虫属 (*Aphelenchoides*) 的线虫,如稻干尖线虫 (贝西拟滑刃线虫 (*Aphelenchoides besseyi*))、菊叶线虫 (菊叶芽滑刃线虫 (*Aphelenchoides ritzemabosi*)) 和草莓线虫 (草莓滑刃线虫 (*Aphelenchoides fragariae*));真滑刃线虫属 (*Aphelenchus*) 的线虫,如食菌线虫 (燕麦真滑刃线虫 (*Aphelenchus avenae*));穿孔线虫属 (*Radopholus*) 的线虫,如掘穴线虫 (相似穿孔线虫 (*Radopholus similis*));半穿刺线虫属 (*Tylenchulus*) 的线虫,如柑橘根线虫 (柑橘半穿刺线虫 (*Tylenchulus semipenetrans*));肾状线虫属 (*Rotylenchulus*) 的线虫,如肾形线虫 (肾形肾状线虫 (*Rotylenchulus reniformis*));存在于树木中的线虫,如松木线虫 (松材线虫 (*Bursaphelenchus xylophilus*)) 和红环线虫 (椰子伞滑刃线虫 (*Bursaphelenchus cocophilus*)) 等。

[0239] 可使用式 (I) 的化合物来保护的植物包括下列植物:例如谷类 (例如,稻、大麦、小麦、黑麦、燕麦、玉米等)、豆类 (大豆、红豆、菜豆、蚕豆、豌豆、花生等)、果树/果类 (苹果、柑橘类、梨、葡萄、桃、日本杏、樱桃、胡桃、苦扁桃、香蕉、草莓等)、蔬菜类 (甘蓝、番茄、菠菜、茎椰菜、莴苣、洋葱、大葱、胡椒等)、根作物 (胡萝卜、马铃薯、甘薯、萝卜、莲藕、芜菁等)、用作

工业原料的植物(棉花、大麻、构树、三桠、油菜、甜菜、蛇麻草、甘蔗、糖用甜菜、橄榄、橡胶、棕榈树、咖啡、烟草、茶等)、葫芦科(南瓜、黄瓜、西瓜、甜瓜等)、牧草植物(鸭茅草、高粱、梯牧草(thimoty-grassa)、三叶草、紫花苜蓿(alfalfa)等)、草坪草(结缕草、剪股颖等)、香料植物(熏衣草、迷迭香、百里香、欧芹、胡椒、姜等)等以及花(菊花、玫瑰、兰花等)。

[0240] 式(I)的化合物特别适用于防治咖啡线虫,特别是最短尾短体线虫、咖啡短体线虫、短小根结线虫、南方根结线虫、咖啡根结线虫、螺旋线虫属种以及巴拉那根结线虫、肾状线虫属种、剑线虫属种、矮化线虫属种、盾线虫属种。

[0241] 式(I)的化合物特别适用于防治马铃薯线虫,特别是最短尾短体线虫、草地短体线虫、斯氏短体线虫、穿刺短体线虫、咖啡短体线虫、鳞球茎线虫以及艾氏短体线虫、安第斯短体线虫、谷类短体线虫、刻痕短体线虫、六裂短体线虫、卢斯短体线虫、落选短体线虫、精美短体线虫、索氏短体线虫、伤残短体线虫、长尾刺线虫、圆筒毛刺线虫、原始毛刺线虫、邻近毛刺线虫、相似毛刺线虫、少见毛刺线虫、微小拟毛刺线虫、葱拟毛刺线虫、短小拟毛刺线虫、光滑拟毛刺线虫、花生根结线虫、伪根结线虫、北方根结线虫、泰晤士根结线虫、南方根结线虫、奇氏根结线虫、爪哇根结线虫、异常科布线虫、马铃薯金线虫、马铃薯白线虫、马铃薯腐烂茎线虫、相似穿孔线虫、肾形肾状线虫、*Neotylenchus vigissi*、假墙草异滑刃线虫(*Paraphelenchus pseudoparietinus*)、草莓滑刃线虫和瓢线虫属种(*Meloidinema* spp.)。

[0242] 式(I)的化合物特别适用于防治番茄线虫,特别是花生根结线虫、北方根结线虫、爪哇根结线虫、南方根结线虫、穿刺短体线虫以及最短尾短体线虫、咖啡短体线虫、斯氏短体线虫、伤残短体线虫、微小拟毛刺线虫、短小根结线虫、异常科布线虫、茄球异皮线虫、异头锥线虫(*Dolichodorus heterocephalus*)和肾形肾状线虫。

[0243] 式(I)的化合物特别适用于防治黄瓜植物线虫,特别是花生根结线虫、北方根结线虫、爪哇根结线虫、南方根结线虫、肾形肾状线虫以及索氏短体线虫。

[0244] 式(I)的化合物特别适用于防治棉花线虫,特别是长尾刺线虫、南方根结线虫、哥伦比亚纽带线虫、帽状纽带线虫和肾形肾状线虫。

[0245] 式(I)的化合物特别适用于防治玉米线虫,特别是长尾刺线虫、微小拟毛刺线虫以及最短尾短体线虫、德式短体线虫、六裂短体线虫、穿刺短体线虫、玉米短体线虫、细小刺线虫、诺顿刺线虫(*Belonolaimus nortoni*)、短环长针线虫、花生根结线虫、*Meloidogyne arenaria thamesi*、禾本科根结线虫、南方根结线虫、*Meloidogyne incognita acrita*、爪哇根结线虫、纳西根结线虫、燕麦异皮线虫、水稻异皮线虫、玉米异皮线虫、查尔科斑皮线虫、鳞球茎线虫、埃及纽带线虫、大针纽带线虫、帽状纽带线虫、印度纽带线虫、双角螺旋线虫、双宫螺旋线虫、假强壮螺旋线虫、美洲剑线虫、异头锥线虫(*Dolichodorus heterocephalus*)、装饰小环线虫、俄尼小环线虫、相似穿孔线虫、北方肾状线虫、微小肾状线虫、农田矮化线虫、清亮矮化线虫、克莱顿矮化线虫、最大矮化线虫、裸矮化线虫、普通矮化线虫、尖锐五沟线虫、微小针线虫、微细鞘线虫、土壤粗纹膜垫线虫、小麦粒癭线虫、花生滑刃线虫、小尾盾线虫和根癭亚慢线虫。

[0246] 式(I)的化合物特别适用于防治大豆线虫,特别是最短尾短体线虫、草地短体线虫、穿刺短体线虫、斯氏短体线虫、长尾刺线虫、大豆异皮线虫、哥伦比亚纽带线虫以及咖啡短体线虫、六裂短体线虫、落选短体线虫、刻痕短体线虫、艾氏短体线虫、敏捷短体线虫、玉米短体线虫、伤残短体线虫、(细小刺线虫)、花生根结线虫、南方根结线虫、爪哇根结线虫、

北方根结线虫、哥伦比亚纽带线虫、帽状纽带线虫和肾形肾状线虫。

[0247] 式(I)的化合物特别适用于防治烟草线虫,特别是南方根结线虫、爪哇根结线虫以及最短尾短体线虫、草地短体线虫、六裂短体线虫、穿刺短体线虫、落选短体线虫、刻痕短体线虫、索氏短体线虫、伤残短体线虫、玉米短体线虫、逃逸长针线虫、裂片拟毛刺线虫(*Paratrichodorus lobatus*)、毛刺线虫属种、花生根结线虫、北方根结线虫、烟草球异皮线虫、茄球异皮线虫、弗吉尼亚球异皮线虫、鳞球茎茎线虫、肾状线虫属种、螺旋线虫属种、美洲剑线虫、小环线虫属种(*Criconemoides* spp.)、肾形肾状线虫、克莱顿矮化线虫、短体线虫属种(*Pratylenchus* spp.)和烟草细垫线虫。

[0248] 式(I)的化合物特别适用于防治柑橘线虫,特别是咖啡短体线虫以及最短尾短体线虫、伤残短体线虫、长尾刺线虫、微小拟毛刺线虫、多孔拟毛刺线虫、毛刺线虫属、南方根结线虫、*Meloidogyne incognita* acrita、爪哇根结线虫、大囊盘旋线虫(*Rotylenchus macrodorus*)、美洲剑线虫、短颈剑线虫、标准剑线虫、小环线虫属种、半小环线虫属、相似穿孔线虫和嗜柑橘穿孔线虫、花生鞘线虫、*Hemicycliophora nudata*和半穿刺线虫。

[0249] 式(I)的化合物特别适用于防治香蕉线虫,特别是咖啡短体线虫、相似穿孔线虫以及圆尾短体线虫、卢斯短体线虫、根结线虫属种、多带螺旋线虫、双宫螺旋线虫和肾状线虫属种。

[0250] 式(I)的化合物特别适用于防治菠萝线虫,特别是玉米短体线虫、草地短体线虫、最短尾短体线虫、古氏短体线虫、根结线虫属种、肾形肾状线虫以及逃逸长针线虫、光头长针线虫(*Longidorus laevis capitatus*)、原始毛刺线虫、微小毛刺线虫、异皮线虫属种、食菌茎线虫、加利福尼亚纽带线虫、拟强壮纽带线虫、印度纽带线虫、双宫螺旋线虫、短小螺旋线虫、多带螺旋线虫、刺桐螺旋线虫、双形尾剑线虫、相似穿孔线虫、指状矮化线虫、伊布里矮化线虫、微小针线虫、格尾盾线虫、缓慢盾线虫、尾粗裸矛线虫、*Psilenchus magnidens*、*Pseudohalenchus minutus*、弗尼亚小环线虫、俄尼小环线虫和畸形小环线虫。

[0251] 式(I)的化合物特别适用于防治葡萄线虫,特别是伤残短体线虫、花生根结线虫、南方根结线虫、爪哇根结线虫、美洲剑线虫、标准剑线虫以及草地短体线虫、斯氏短体线虫、落选短体线虫、最短尾短体线虫、索氏短体线虫和半穿刺线虫。

[0252] 式(I)的化合物特别适用于防治木本作物——仁果类线虫,特别是穿刺短体线虫以及伤残短体线虫、逃逸长针线虫、南方根结线虫和北方根结线虫。

[0253] 式(I)的化合物特别适用于防治木本作物——核果类线虫,特别是穿刺短体线虫、伤残短体线虫、花生根结线虫、北方根结线虫、爪哇根结线虫、南方根结线虫、薄叶小环线虫以及最短尾短体线虫、咖啡短体线虫、斯氏短体线虫、玉米短体线虫、长尾刺线虫、双宫螺旋线虫、美洲剑线虫、弯曲小环线虫、克莱顿矮化线虫、钩针线虫、突出针线虫、小尾盾线虫和帽状纽带线虫。

[0254] 式(I)的化合物特别适用于防治木本作物、甘蔗和稻中的线虫,特别是毛刺线虫属种、小环线虫属种(*Criconemella* spp.)以及短体线虫属种、拟毛刺线虫属种、根结线虫属种、螺旋线虫属种、矮化线虫属种、滑刃线虫属种、异皮线虫属种、剑线虫属种和*Cacopaurus pestis*。

[0255] 在本文中,术语“线虫”还指侵害人或动物的线虫。

[0256] 对人或动物有害的具体线虫物种为:

[0257] 毛形亚目(Trichinellida)的线虫,例如,鞭虫属种(*Trichuris* spp.)、毛细线虫属种(*Capillaria* spp.)、*Paracapillaria*属种、真鞘线虫属种(*Eucoleus* spp.)、*Trichomosoides*属种、毛线虫属种(*Trichinella* spp.);

[0258] 垫刃目(Tylenchida)的线虫,例如,微线虫属种(*Micronema* spp.)、粪圆线虫属种(*Strongyloides* spp.);

[0259] 小杆亚目(Rhabditina)的线虫,例如:圆线虫属种(*Strongylus* spp.)、三齿线虫属种(*Triodontophorus* spp.)、食管齿线虫属种(*Oesophagodontus* spp.)、毛线线虫属种(*Trichonema* spp.)、辐首线虫属种(*Gyalocephalus* spp.)、柱咽线虫属种(*Cylindropharynx* spp.)、杯口线虫属种(*Poteriostomum* spp.)、*Cyclococercus*属种、杯冠线虫属种(*Cylicostephanus* spp.)、结节线虫属种(*Oesophagostomum* spp.)、夏柏特线虫属种(*Chabertia* spp.)、肾线虫属种(*Stephanurus* spp.)、钩口线虫属种(*Ancylostoma* spp.)、钩虫属种(*Uncinaria* spp.)、板口线虫属种(*Necator* spp.)、仰口线虫属种(*Bunostomum* spp.)、球头线虫属种(*Globocephalus* spp.)、比翼线虫属种(*Syngamus* spp.)、盅口线虫属种(*Cyathostoma* spp.)、后圆线虫属种(*Metastrongylus* spp.)、网尾线虫属种(*Dictyocaulus* spp.)、缪勒线虫属种(*Muellerius* spp.)、原圆线虫属种(*Protostrongylus* spp.)、新圆线虫属种(*Neoststrongylus* spp.)、囊尾属种(*Cystocaulus* spp.)、肺圆线虫属种(*Pneumoststrongylus* spp.)、*Spicocaulus*属种、麋圆线虫属种(*Elaphoststrongylus* spp.)、拟马鹿圆线虫属种(*Parelaphoststrongylus* spp.)、环体线虫属种(*Crenosoma* spp.)、*Paracrenosoma*属种、奥斯勒丝虫属种(*Oslerus* spp.)、管圆线虫属种(*Angiostrongylus* spp.)、猫圆线虫属种(*Aelurostrongylus* spp.)、类丝虫属种(*Filaroides* spp.)、副类丝虫属种(*Parafilaroides* spp.)、毛圆线虫属种(*Trichostrongylus* spp.)、血矛线虫属种(*Haemonchus* spp.)、胃线虫属种(*Ostertagia* spp.)、背带丝虫属种(*Teladorsagia* spp.)、马歇尔线虫属种(*Marshallagia* spp.)、古柏线虫属种(*Cooperia* spp.)、日圆线虫属种(*Nippostrongylus* spp.)、似绕体线虫属种(*Heligmosomoides* spp.)、细颈线虫属种(*Nematodirus* spp.)、猪圆形线虫属种(*Hyostrongylus* spp.)、尖柱线虫属种(*Obeliscoides* spp.)、裂口线虫属种(*Amidostomum* spp.)、沃鲁线虫属种(*Ollulanus* spp.);

[0260] 旋尾目(Spirurida)的线虫,例如:尖尾线虫属种(*Oxyuris* spp.)、蛲虫属种(*Enterobius* spp.)、栓尾线虫属种(*Passalurus* spp.)、管状线虫属种(*Syphacia* spp.)、无刺线虫属种(*Aspiculuris* spp.)、异刺线虫属种(*Heterakis* spp.)、蛔虫属种(*Ascaris* spp.)、弓蛔线虫属种(*Toxascaris* spp.)、弓蛔虫属种(*Toxocara* spp.)、贝利蛔线虫属种(*Baylisascaris* spp.)、副蛔虫属种(*Parascaris* spp.)、异尖属种(*Anisakis* spp.)、鸡蛔虫属种(*Ascaridia* spp.)、顎口线虫属种(*Gnathostoma* spp.)、泡翼线虫属种(*Physaloptera* spp.)、吸吮线虫属种(*Thelazia* spp.)、筒线属种(*Gongylonema* spp.)、丽线虫属种(*Habronema* spp.)、副柔线虫属种(*Parabronema* spp.)、德拉西线虫属种(*Draschia* spp.)、尤线虫属种(*Dracunculus* spp.)、冠丝虫属种(*Stephanofilaria* spp.)、副丝虫属种(*Parafilaria* spp.)、腹腔丝虫属种(*Setaria* spp.)、罗阿丝虫属种(*Loa* spp.)、恶丝虫属种(*Dirofilaria* spp.)、光丝虫属种(*Litomosoides* spp.)、布鲁丝虫属种(*Brugia* spp.)、吴策线虫属种(*Wuchereria* spp.)、盘尾丝虫属种(*Onchocerca*

spp.)、旋尾线虫属种(*Spirocerca* spp.)。

[0261] 许多已知的杀线虫剂还作用于其它寄生蠕虫,并因此用于防治蠕虫——不一定属于线虫类——其是人体和动物中的寄生虫。本发明还涉及式(I)的化合物作为抗蠕虫药剂的用途。病原性内寄生蠕虫包括扁形动物门(例如单殖亚纲(*Monogenea*)、绦虫(*cestodes*)和吸虫(*trematodes*))、棘头动物门(*Acanthocephala*)和舌形虫属种(*Pentastoma*)。可优选提及下列蠕虫:

[0262] 单殖亚纲:例如:三代虫属种(*Gyrodactylus* spp.)、指环虫属种(*Dactylogyrus* spp.)、多盘吸虫属种(*Polystoma* spp.);

[0263] 绦虫:假叶目(*Pseudophyllidea*),例如:裂头属种(*Diphyllbothrium* spp.)、迭宫绦虫属种(*Spirometra* spp.)、裂头绦虫属种(*Schistocephalus* spp.)、舌状绦虫属种(*Ligula* spp.)、突盘绦虫属种(*Bothridium* spp.)、复殖孔绦虫属种(*Diplogonoporus* spp.);

[0264] 圆叶目(*Cyclophyllida*),例如:中殖孔绦虫属种(*Mesocestoides* spp.)、裸头绦虫属种(*Anoplocephala* spp.)、副裸头绦虫属种(*Paranoplocephala* spp.)、蒙尼茨绦虫属种(*Moniezia* spp.)、燧体绦虫属种(*Thysanosoma* spp.)、曲子宫绦虫属种(*Thysaniezia* spp.)、无卵黄腺绦虫属种(*Avitellina* spp.)、斯泰绦虫属种(*Stilesia* spp.)、鸣绦虫属种(*Cittotaenia* spp.)、*Anhyra*属种、伯特绦虫属种(*Bertiella* spp.)、带绦虫属种(*Taenia* spp.)、棘球绦虫属种(*Echinococcus* spp.)、泡尾绦虫属种(*Hydratigera* spp.)、戴文氏绦虫属种(*Davainea* spp.)、瑞列绦虫属种(*Raillietina* spp.)、膜壳绦虫属种(*Hymenolepsis* spp.)、棘鳞绦虫属种(*Echinolepsis* spp.)、*Echinocotyle*属种、双睾绦虫属种(*Diorchis* spp.)、复孔绦虫属种(*Dipylidium* spp.)、约优克斯绦虫属种(*Joyeuxiella* spp.)、复孔绦虫属种(*Diplopylidium* spp.);

[0265] 吸虫:复殖亚纲(*Digenea*),例如:双穴吸虫属种(*Diplostomum* spp.)、茎穴吸虫属种(*Posthodiplostomum* spp.)、血吸虫属种(*Schistosoma* spp.)、毛毕吸虫属种(*Trichobilharzia* spp.)、鸟毕吸虫属种(*Ornithobilharzia* spp.)、澳毕吸虫属种(*Austroilharzia* spp.)、巨毕吸虫属种(*Gigantobilharzia* spp.)、彩蚴吸虫属种(*Leucochloridium* spp.)、短咽吸虫属种(*Brachylaima* spp.)、棘口吸虫属种(*Echinostoma* spp.)、棘缘吸虫属种(*Echinoparyphium* spp.)、棘隙吸虫属种(*Echinochasmus* spp.)、低颈吸虫属种(*Hypoderaeum* spp.)、片形吸虫属种(*Fasciola* spp.)、*Fasciolides*属种、姜片吸虫属种(*Fasciolopsis* spp.)、环腔吸虫属种(*Cyclocoelum* spp.)、盲腔吸虫属种(*Typhlocoelum* spp.)、同端盘吸虫属种(*Paramphistomum* spp.)、杯殖吸虫属种(*Calicophoron* spp.)、殖盘吸虫属种(*Cotylphoron* spp.)、巨孔吸虫属种(*Gigantocotyle* spp.)、菲策吸虫属种(*Fischoederius* spp.)、腹袋吸虫属种(*Gastrothylacus* spp.)、背孔吸虫属种(*Notocotylus* spp.)、下弯吸虫属种(*Catatropis* spp.)、斜睾吸虫属种(*Plagiorchis* spp.)、前殖吸虫属种(*Prosthogonimus* spp.)、双腔吸虫属种(*Dicrocoelium* spp.)、阔盘吸虫属种(*Eurytrema* spp.)、隐孔吸虫属种(*Troglootrema* spp.)、并殖吸虫属种(*Paragonimus* spp.)、肛瘤吸虫属种(*Collyriclum* spp.)、侏形吸虫属种(*Nanophyetus* spp.)、后睾吸虫属种(*Opisthorchis* spp.)、支睾吸虫属种(*Clonorchis* spp.)、次睾吸虫

属种 (*Metorchis* spp.)、异形吸虫属种 (*Heterophyes* spp.)、后殖吸虫属种 (*Metagonimus* spp.)；

[0266] 棘头虫纲：少棘目 (*Oligacanthorhynchida*)，例如：巨吻棘头虫属种 (*Macracanthorhynchus* spp.)、前睾棘头虫属种 (*Prosthenorchis* spp.)；多形目 (*Polymorphida*)，例如：细颈棘头虫属种 (*Filicollis* spp.)；念珠目 (*Moniliformida*)，例如：念珠棘虫属种 (*Moniliformis* spp.)；

[0267] 棘吻目 (*Echinorhynchida*)，例如，棘头虫属种 (*Acanthocephalus* spp.)、棘吻虫属种 (*Echinorhynchus* spp.)、似细吻棘头虫属种 (*Leptorhynchoides* spp.)；

[0268] 舌形动物门：蛇舌状虫目 (*Porocephalida*)，例如，舌形虫属种 (*Linguatula* spp.)。

[0269] 在兽医学领域和动物饲养中，式 (I) 的化合物的给药以已知的方式以合适的使用形式直接或经肠内、经肠胃外、经皮或经鼻进行。给药可以是预防性的或治疗性的。

[0270] 在某些浓度或施用率下，式 (I) 的化合物还可以任选地用作除草剂、安全剂、生长调节剂或改进植物特性的试剂，用作杀微生物剂和杀配子剂，例如用作杀真菌剂、抗真菌剂、杀细菌剂、杀病毒剂 (包括抵抗类病毒的试剂) 或用作抵抗 MLO (类支原体生物) 和 RLO (类立克次氏体生物) 的试剂。如果合适的话，它们还可以用作用于合成其它活性化合物的中间体或前体。

[0271] 制剂

[0272] 本发明还涉及作为农药的制剂和由其制备的使用形式 (例如浸液、滴液和喷雾液体)，其包含至少一种式 (I) 的化合物。在某些情况下，所述使用形式还包含农药和/或改善作用的佐剂如渗透剂，例如植物油 (例如菜籽油、葵花油)、矿物油 (例如石蜡油)、植物脂肪酸的烷基酯 (例如菜籽油甲酯或大豆油甲酯) 或烷醇烷氧基化物；和/或铺展剂，例如烷基硅氧烷；和/或盐，例如有机或无机铵盐或磷盐，例如硫酸铵或磷酸氢二铵；和/或保持促进剂，例如磺基丁二酸二辛酯或羟丙基瓜尔胶聚合物；和/或保湿剂，例如丙三醇；和/或肥料，例如铵肥、钾肥或磷肥。

[0273] 常规制剂为，例如，水溶性液剂 (SL)、乳液浓缩剂 (EC)、水乳剂 (EW)、悬浮浓缩剂 (SC、SE、FS、OD)、水分散性颗粒剂 (WG)、颗粒剂 (GR) 和胶囊浓缩剂 (CS)；这些制剂和其他可能的制剂类型例如由国际作物生命 (Crop Life International) 记载，并记载于农药说明书 (Pesticide Specifications)、联合国粮农组织和世界卫生组织农药说明书开发与使用手册 (Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides)、联合国粮农组织植物生产与保护文献-173 (FAO Plant Production and Protection Papers-173) (由联合国粮农组织/世界卫生组织关于农药说明书的联合会议制定，2004，ISBN:9251048576)。除一种或更多种式 (I) 的化合物之外，所述制剂还任选地包含其他农业化学活性化合物。

[0274] 优选包含助剂的制剂或使用形式，所述助剂为例如增量剂、溶剂、自发性促进剂、载体、乳化剂、分散剂、防冻剂、杀生物剂 (biocide)、增稠剂；和/或其他助剂，例如佐剂。在本文中，佐剂是增强制剂的生物效应的组分，而该组分本身不具有任何生物效应。佐剂的实例为促进保持、铺展、附着到叶片表面或渗透的试剂。

[0275] 这些制剂是以已知的方式制备的，例如通过将式 (I) 的化合物与助剂 (例如增量

剂、溶剂和/或固体载体)和/或其他助剂(例如表面活性剂)混合来制备。所述制剂在合适的设备中制备,或在施用之前或施用过程中制备。

[0276] 所用的助剂可以为适用于赋予式(I)的化合物的制剂或由这些制剂制备的使用形式(例如即用型农药,如喷雾液剂或拌种产品)特殊性质(例如某些物理的、技术的和/或生物学性质)的物质。

[0277] 合适的增量剂为,例如,水、极性和非极性有机化学液体,例如选自芳族和非芳族烃类(例如石蜡、烷基苯、烷基萘、氯苯)、醇和多元醇(如果合适,其还可被取代、醚化和/或酯化)、酮(例如丙酮、环己酮)、酯(包括脂肪和油)以及(聚)醚、未取代和取代的胺、酰胺、内酰胺(例如N-烷基吡咯烷酮)以及内酯、砜和亚砜(例如二甲基亚砜)。

[0278] 如果所用的增量剂为水,则还可使用例如有机溶剂作为助溶剂。有用的液体溶剂主要为:芳族化合物,如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯代芳族烃或氯代脂族烃,如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,如环己烷或石蜡,例如矿物油馏分、矿物油和植物油;醇(例如丁醇或乙二醇)及其醚和酯;酮,如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂,例如二甲基甲酰胺和二甲基亚砜;以及水。

[0279] 原则上,可使用所有合适的溶剂。合适的溶剂的实例为芳族烃,例如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯代芳族烃或脂族烃,例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,例如环己烷、石蜡、矿物油馏分、矿物油和植物油;醇,例如甲醇、乙醇、异丙醇、丁醇或乙二醇,及其醚和酯;酮,例如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂,例如二甲基亚砜;以及水。

[0280] 原则上,可使用所有合适的载体。有用的载体尤其包括:例如,铵盐和粉碎的天然矿物(例如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、硅镁土、蒙脱石或硅藻土),和粉碎的合成矿物质(例如细分散的二氧化硅、氧化铝)以及天然或合成的硅酸盐、树脂、蜡和/或固体肥料。同样可使用所述载体的混合物。用于颗粒剂的有用载体包括:例如,粉碎并分级的天然岩石(例如方解石、大理石、浮石、海泡石、白云石),和无机和有机粉状物的合成颗粒,以及有机材料(例如锯屑、纸、椰壳、玉米及烟草秸秆)的颗粒。

[0281] 还可使用液化的气体增量剂或溶剂。尤其合适的是在标准温度和大气压力下为气态的那些增量剂或载体,例如气溶胶推进剂(例如卤代烃),以及丁烷、丙烷、氮气和二氧化碳。

[0282] 具有离子或非离子特性的乳化剂和/或发泡剂、分散剂或润湿剂,或这些表面活性物质的混合物的实例为:聚丙烯酸的盐;木素磺酸的盐;苯酚磺酸或萘磺酸的盐;环氧乙烷与脂肪醇或与脂肪酸或与脂肪胺、与取代的苯酚(优选烷基酚或芳基酚)的缩聚物;磺基丁二酸酯的盐;牛磺酸衍生物(优选牛磺酸烷基酯);聚乙氧基化醇或酚的磷酸酯;多元醇的脂肪酸酯;以及含有硫酸盐、磺酸盐和磷酸盐的化合物的衍生物,例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐、蛋白质水解物、木素亚硫酸盐废液及甲基纤维素。如果式(I)的化合物中的一种和/或惰性载体中的一种不溶于水并且当在水中进行施用,则表面活性剂的存在是有利的。

[0283] 可存在于所述制剂及由其获得的使用形式中的其他助剂为染料如无机颜料,例如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝;和有机染料,例如茜素染料、偶氮染料及金属酞菁染料;以及营养素和微量营养素,例如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐。

[0284] 可存在的另外的组分为稳定剂(例如低温稳定剂)、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂或

改进化学和/或物理稳定性的其他试剂。还可存在发泡剂或消泡剂。

[0285] 此外,所述制剂及由其获得的使用形式还可包含以下物质作为另外的助剂:粘着剂,例如羧甲基纤维素;以及以粉末、颗粒或胶乳形式的天然和合成聚合物,例如阿拉伯树胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯;或天然磷脂(例如脑磷脂和卵磷脂)和合成磷脂。其他助剂可为矿物油和植物油。

[0286] 如果合适,所述制剂及由其获得的使用形式中还可以存在其他助剂。这类添加剂的实例为香料、保护胶体、粘结剂(binder)、粘合剂(adhesive)、增稠剂、触变剂、渗透剂、保持促进剂、稳定剂、螯合剂、络合剂、保湿剂、铺展剂。通常,式(I)的化合物可与常用于制剂目的的任何固体或液体添加剂结合。

[0287] 有用的保持促进剂包括所有那些降低动力学表面张力的物质(例如磺基丁二酸二辛酯)或增加粘弹性的物质(例如羟丙基瓜尔胶聚合物)。

[0288] 在本文中,合适的渗透剂为所有那些常用于改进农用化学活性化合物向植物内渗透的物质。在本上下文中,渗透剂定义为:其从(通常为含水的)施用液剂和/或从喷雾涂层向植物表皮中渗透从而提高活性化合物在表皮中迁移的能力。可使用文献(Baur等人,1997,Pesticide Science 51,131-152)中记载的方法来测定该特性。实例包括醇烷氧基化物,例如椰子脂肪乙氧基化物(10)或异十三烷基乙氧基化物(12);脂肪酸酯,例如菜籽油甲酯或大豆油甲酯;脂肪胺烷氧基化物,例如牛脂胺乙氧基化物(15);或者铵盐和/或磷盐,例如硫酸铵或磷酸氢二铵。

[0289] 所述制剂优选包含0.00000001重量%至98重量%的式(I)的化合物,更优选0.01重量%至95重量%的式(I)的化合物,最优选0.5重量%至90重量%的式(I)的化合物,基于该制剂的重量计。

[0290] 在由所述制剂制备的使用形式(特别是农药)中,式(I)的化合物的含量可在宽的范围内变化。所述使用形式中的式(I)的化合物的浓度通常可为0.00000001重量%至95重量%的式(I)的化合物,优选0.00001重量%至1重量%,基于所述使用形式的重量计。以适于使用形式的常规方式进行施用。

[0291] 混合物

[0292] 式(I)的化合物还可以与一种或多种合适的杀真菌剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀软体动物剂、杀线虫剂、杀昆虫剂、微生物剂(microbiological agent)、有益生物(beneficial organisms)、除草剂、肥料、驱鸟剂、植物性毒素(phytotoxic)、止繁殖剂、安全剂、化学信息素和/或植物生长调节剂混合使用,从而由此例如拓宽作用谱、延长作用时间、提高作用速率、防止排斥或防止抗性发展。另外,这种活性化合物结合物可改善植物生长和/或提高对非生物因素(例如高温或低温、干旱或高含水量或土壤盐度)的耐受性。还可改善开花和结果的性能、优化发芽能力和根系发育、促进采收并提高产量、影响成熟、提高采收产品的品质和/或营养价值、延长采收产品的储存期限和/或提高其可加工性。

[0293] 此外,式(I)的化合物可以与其他活性化合物或化学信息素(例如引诱剂和/或驱鸟剂和/或植物活化剂和/或生长调节剂和/或肥料)以混合物的形式存在。同样,式(I)的化合物可以与改善植物特性(例如生长、采收材料的产量和品质)的试剂混合使用。

[0294] 在本发明的一个具体的实施方案中,在制剂或由这些制剂制备的使用形式中,式(I)的化合物与其他化合物——优选下文所述的那些化合物——以混合物的形式存在。

[0295] 如果下述化合物的一种可以不同的互变异构的形式存在,则这些形式也包括在内,即使在每种情况下没有明确提及。

[0296] 杀昆虫剂/杀螨剂/杀线虫剂

[0297] 本文中以其通用名称说明的活性化合物是已知的,并且记载于例如“农药手册(The Pesticide Manual)”,第16版,英国作物保护委员会(BritishCropProtectionCouncil)2012中,或可在网站(例如<http://www.alanwood.net/pesticides>)上搜索到。

[0298] (1) 乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂,例如氨基甲酸酯类,如棉铃威(alanycarb)、涕灭威(aldicarb)、噁虫威(bendiocarb)、丙硫克百威(benfuracarb)、丁酮威(butocarboxim)、丁酮砜威(butoxycarboxim)、甲萘威(carbaryl)、克百威(carbofuran)、丁硫克百威(carbosulfan)、乙硫苯威(ethiofencarb)、仲丁威(fenobucarb)、伐虫脒(formetanate)、呋线威(furathiocarb)、异丙威(isoprocarb)、甲硫威(methiocarb)、灭多威(methomyl)、速灭威(metolcarb)、杀线威(oxamyl)、抗蚜威(pirimicarb)、残杀威(propoxur)、硫双威(thiodicarb)、久效威(thiofanox)、啉蚜威(triazamate)、混杀威(trimethacarb)、灭除威(XMC)和灭杀威(xylylcarb);或有机磷酸酯类,如乙酰甲胺磷(acephate)、甲基吡恶磷(azamethiphos)、乙基谷硫磷(azinphos-ethyl)、甲基谷硫磷(azinphos-methyl)、硫线磷(cadusafos)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、毒虫畏(chlorfenvinphos)、氯甲磷(chlormephos)、毒死蜱(chlorpyrifos)、甲基毒死蜱(chlorpyrifos-methyl)、蝇毒磷(coumaphos)、杀螟腈(cyanophos)、甲基内吸磷(demeton-S-methyl)、二嗪农(diazinon)、敌敌畏(dichlorvos)/DDVP、百治磷(dicrotophos)、乐果(dimethoate)、甲基毒虫畏(dimethylvinphos)、乙拌磷(disulfoton)、苯硫磷(EPN)、乙硫磷(ethion)、灭线磷(ethoprophos)、伐灭磷(famphur)、苯线磷(fenamiphos)、杀螟硫磷(fenitrothion)、倍硫磷(fenthion)、噻唑磷(fosthiazate)、庚烯磷(heptenophos)、imicyafos、异柳磷(isofenphos)、0-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸异丙酯、异噁唑磷(isoxathion)、马拉硫磷(malathion)、灭蚜磷(mecarbam)、甲胺磷(methamidophos)、杀扑磷(methidathion)、速灭磷(mevinphos)、久效磷(monocrotophos)、二溴磷(naled)、氧化乐果(omethoate)、亚砷磷(oxydemeton-methyl)、对硫磷(parathion)、甲基对硫磷(parathion-methyl)、稻丰散(phenthoate)、甲拌磷(phorate)、伏杀硫磷(phosalone)、亚胺硫磷(phosmet)、磷胺(phosphamidon)、辛硫磷(phoxim)、甲基嘧啶磷(pirimiphos-methyl)、丙溴磷(profenofos)、胺丙畏(propetamphos)、丙硫磷(prothiofos)、吡唑硫磷(pyraclofos)、啉啉硫磷(pyridaphenthion)、喹噁磷(quinalphos)、治螟磷(sulfotep)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、双硫磷(temephos)、特丁硫磷(terbufos)、杀虫畏(tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷(thiometon)、三唑磷(triazophos)、敌百虫(triclorfon)和蚜灭磷(vamidothion);

[0299] (2) GABA门控氯离子通道拮抗剂,例如环戊二烯有机氯类,如氯丹(chlordane)和硫丹(endosulfan);或苯基吡唑类(fiproles),如乙虫腈(ethiprole)和氟虫腈(fipronil);

[0300] (3) 钠通道调节剂/电压门控钠通道阻断剂,例如拟除虫菊酯(pyrethroid)类,例如氟丙菊酯(acrinathrin)、丙烯菊酯(allethrin)、d-顺-反烯丙菊酯(d-cis-trans

allethrin)、d-反丙烯菊酯(d-trans allethrin)、联苯菊酯(bifenthrin)、生物烯丙菊酯(bioallethrin)、生物烯丙菊酯S-环戊烯基异构体(bioallethrin S-cyclopentenyl isomer)、生物苄呋菊酯(bioresmethrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、氟氯氰菊酯(cyfluthrin)、 β -氟氯氰菊酯(beta-cyfluthrin)、氯氟氰菊酯(cyhalothrin)、 λ -氯氟氰菊酯(lambda-cyhalothrin)、 γ -氯氟氰菊酯(gamma-cyhalothrin)、氯氰菊酯(cypermethrin)、 α -氯氰菊酯(alpha-cypermethrin)、 β -氯氰菊酯(beta-cypermethrin)、 θ -氯氰菊酯(theta-cypermethrin)、 ζ -氯氰菊酯(zeta-cypermethrin)、苯醚氰菊酯[(1R)-反式异构体](cyphenothrin[(1R)-trans-isomers])、溴氰菊酯(deltamethrin)、右旋烯炔菊酯[(EZ)-(1R)异构体](empenthrin[(EZ)-(1R)-isomers])、高氰戊菊酯(esfenvalerate)、醚菊酯(etofenprox)、甲氰菊酯(fenpropathrin)、氰戊菊酯(fenvalerate)、氟氰戊菊酯(flucythrinate)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、 τ -氟胺氰菊酯(tau-fluvalinate)、苄螨醚(halfenprox)、咪炔菊酯(imiprothrin)、噁恩菊酯(kadethrin)、momfluorothrin、氯菊酯(permethrin)、苯醚菊酯[(1R)-反式异构体](phenothrin[(1R)-trans-isomer])、炔丙菊酯(prallethrin)、除虫菊素(pyrethrine)(除虫菊(pyrethrum))、苄呋菊酯(resmethrin)、氟硅菊酯(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin)、胺菊酯(tetramethrin)、胺菊酯[(1R)-异构体](tetramethrin[(1R)-isomer])、四溴菊酯(tralomethrin)和四氟菊酯(transfluthrin);或滴滴涕(DDT);或甲氧滴滴涕(methoxychlor);

[0301] (4) 烟碱能乙酰胆碱受体(nAChR)激动剂,例如新烟碱类(neonicotinoids),如啉虫脒(acetamiprid)、噁虫胺(clothianidin)、呋虫胺(dinotefuran)、吡虫啉(imidacloprid)、烯啶虫胺(nitenpyram)、噁虫啉(thiacloprid)和噁虫嗪(thiamethoxam);或烟碱(nicotine);或砒虫啉(sulfoxaflor);或氟吡呋喃酮(flupyradifurone);

[0302] (5) 烟碱能乙酰胆碱受体(nAChR)变构活化剂,例如多杀霉素类(spinosyns),例如乙基多杀霉素(spinetoram)和多杀菌素(spinosad);

[0303] (6) 氯离子通道活化剂,例如阿维菌素类(avermectins)/米尔倍霉素类(milbemycins),如阿巴克丁(abamectin)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐(emamectinbenzoate)、雷皮菌素(lepimectin)和弥拜菌素(milbemectin);

[0304] (7) 保幼激素模拟物(Juvenilehormoneimitator),例如保幼激素类似物,例如烯虫乙酯(hydroprene)、烯虫炔酯(kinoprene)和烯虫酯(methoprene);或苯氧威(fenoxycarb);或吡丙醚(pyriproxyfen);

[0305] (8) 具有未知的或不明确的作用机理的活性化合物,例如

[0306] 烷基卤化物,如溴甲烷和其他烷基卤化物;或氯化苦(chloropicrin);或硫酰氟(sulphurylfluoride);或硼砂(borax);或吐酒石(tartaremetic);

[0307] (9) 选择性拒食剂,例如吡蚜酮(pymetrozine)或氟啶虫酰胺(flonicamid);

[0308] (10) 螨生长抑制剂,例如四螨嗪(clofentezine)、噁螨酮(hexythiazox)和氟螨啉(diflovidazin);或乙螨唑(etoxazole);

[0309] (11) 昆虫肠膜的微生物干扰剂,例如苏云金芽孢杆菌以色列亚种(*Bacillus thuringiensis* subspecies *israelensis*)、球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus*)、苏云

金芽孢杆菌鲎泽亚种 (*Bacillus thuringiensis* subspecies *aizawai*)、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种 (*Bacillus thuringiensis* subspecies *kurstaki*)、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种 (*Bacillus thuringiensis* subspecies *tenebrionis*)，和BT植物蛋白质：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab1；

[0310] (12) 氧化磷酸化抑制剂，ATP干扰剂，例如丁醚脲 (diafenthiuron)；或有机锡化合物类，例如三唑锡 (azocyclotin)、三环锡 (cyhexatin) 和苯丁锡 (fenbutatin oxide)；或克螨特 (propargite)；或四氯杀螨砒 (tetradifon)；

[0311] (13) 中断H⁺质子梯度的氧化磷酸化解偶联剂，例如虫螨腈 (chlorfenapyr)、DNOC和氟虫胺 (sulfluramid)；

[0312] (14) 烟碱能乙酰胆碱受体拮抗剂，例如杀虫磺 (bensultap)、杀螟丹盐酸盐 (cartap hydrochloride)、杀虫环 (thiocylam) 和杀虫双 (thiosultap-sodium)；

[0313] (15) O型几丁质生物合成抑制剂，例如双三氟虫脲 (bistrifluron)、氟啶脲 (chlorfluazuron)、除虫脲 (diflubenzuron)、氟环脲 (flucyclohexuron)、氟虫脲 (flufenoxuron)、氟铃脲 (hexaflumuron)、虱螨脲 (lufenuron)、氟酰脲 (novaluron)、多氟脲 (noviflumuron)、氟苯脲 (teflubenzuron) 和杀铃脲 (triflumuron)；

[0314] (16) I型几丁质生物合成抑制剂，例如噻嗪酮 (buprofezin)；

[0315] (17) 蜕皮抑制剂 (特别是用于双翅目，即双翅类)，例如，灭蝇胺 (cyromazine)；

[0316] (18) 蜕皮激素受体激动剂，例如环虫酰肼 (chromafenozide)、氯虫酰肼 (halofenozide)、甲氧虫酰肼 (methoxyfenozide) 和虫酰肼 (tebufenozide)；

[0317] (19) 章鱼胺能激动剂，例如双甲脒 (amitraz)；

[0318] (20) 复合物-III电子转移抑制剂，例如氟蚁腓 (hydramethylnon)；或灭螨醌 (acequinocyl)；或噻螨酯 (fluacrypyrim)；

[0319] (21) 复合物-I电子转移抑制剂，例如METI杀螨剂类，例如喹螨醚 (fenazaquin)、唑螨酯 (fenpyroximate)、噻螨醚 (pyrimidifen)、吡螨灵 (pyridaben)、吡螨胺 (tebufenpyrad) 和唑虫酰胺 (tolfenpyrad) 或鱼藤酮 (rotenone) (鱼藤属 (*Derris*))；

[0320] (22) 电压门控钠通道阻断剂，例如茚虫威 (indoxacarb) 或氰氟虫腓 (metaflumizone)；

[0321] (23) 乙酰辅酶A羧化酶抑制剂，例如，特窗酸 (tetronic acid) 和特特拉姆酸 (tetramic acid) 衍生物，例如螺螨酯 (spirodiclofen)、螺甲螨酯 (spiromesifen) 和螺虫乙酯 (spirotetramat)；

[0322] (24) 复合物-IV电子转移抑制剂，例如，膦类，如磷化铝、磷化钙、膦和磷化锌；或氰化物；

[0323] (25) 复合物-II电子转移抑制剂，例如，唑螨氰 (cyenopyrafen) 和丁氟螨酯 (cyflumetofen)；

[0324] (28) 兰尼碱受体效应物，例如，二酰胺类，如氯虫酰胺 (chlorantraniliprole)、氰虫酰胺 (cyantraniliprole) 和氟虫酰胺 (flubendiamide)；

[0325] 作用机理未知或不清楚的其他活性化合物，例如afidopyropen、afoxolaner、印楝素 (azadirachtin)、benclothiaz、苯螨特 (benzoximate)、联苯肼酯 (bifenazate)、溴虫氟苯双酰胺 (Broflanilide)、溴螨酯 (bromopropylate)、灭螨猛 (chinomethionat)、冰晶石

(cryolite)、环溴虫酰胺(cyclaniliprole)、环氧虫啉(cycloxaprid)、氯氟氰虫酰胺(cyhalodiamide)、dicloromezotiaz、三氯杀螨醇(dicofol)、氟螨嗪(diflovidazin)、flometoquin、fluazaindolizine、氟噻虫砒(fluensulfone)、嘧虫胺(flufenerim)、氟菌酯(flufenoxystrobin)、丁虫腈(flufiprole)、fluhexafon、氟吡菌酰胺(fluopyram)、fluralaner、fluxametamide、呋喃虫酰胺(fufenozide)、戊吡虫胍(Guadipyr)、heptafluthrin、氯噻啉(imidaclothiz)、异菌脲(iprodione)、lotilaner、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、啖虫啉(paichongding)、pyflubumide、啖虫丙醚(pyridalyl)、pyrifluquinazon、嘧啉胺(pyriminostrobin)、sarolaner、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)、氟氰虫酰胺(tetraniliprole)、氯虫苯甲酰胺(tetrachlorantraniliprole)、tioxazafen、triflumezopyrim和碘甲烷;和另外基于坚强芽孢杆菌(*Bacillus firmus*) (I-1582, BioNeem, Votivo) 的制剂, 以及以下已知的活性化合物: 1-{2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亚磺酰基]苯基}-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺(已知于W02006/043635)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吡啶-3,4'-哌啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮(已知于W02003/106457)、2-氯-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]哌啶-4-基}-4-(三氟甲基)苯基]异烟酰胺(已知于W02006/003494)、3-(2,5-二甲基苯基)-4-羟基-8-甲氧基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(已知于W02009/049851)、3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基-乙基碳酸酯(已知于W02009/049851)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基哌啶-1-基)-5-氟嘧啶(已知于W02004/099160)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3-氯苯基)嘧啶(已知于W02003/076415)、PF1364(CAS登录号1204776-60-2)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)-5-氯-3-甲基苯甲酰基]-2-甲基肼羧酸甲酯(已知于W02005/085216)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)-5-氰基-3-甲基苯甲酰基]-2-乙基肼羧酸甲酯(已知于W02005/085216)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)-5-氰基-3-甲基苯甲酰基]-2-甲基肼羧酸甲酯(已知于W02005/085216)、2-[3,5-二溴-2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)苯甲酰基]-2-乙基肼羧酸甲酯(已知于W02005/085216)、N-[2-(5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-甲酰胺(已知于CN102057925)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-(1-氧桥硫杂环丁烷-3-基)苯甲酰胺(已知于W02009/080250)、N-[(2E)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]吡啶-2(1H)-亚基]-2,2,2-三氟乙酰胺(已知于W02012/029672)、1-[(2-氯-1,3-噻唑-5-基)甲基]-4-氧代-3-苯基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶-1-鎓-2-醇盐(已知于W02009/099929)、1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-4-氧代-3-苯基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶-1-鎓-2-醇盐(已知于W02009/099929)、4-(3-{2,6-二氯-4-[(3,3-二氯丙-2-烯-1-基)氧基]苯氧基}丙氧基)-2-甲氧基-6-(三氟甲基)嘧啶(已知于CN101337940)、N-[2-(叔丁基氨基甲酰基)-4-氯-6-甲基苯基]-1-(3-氯吡啶-2-基)-3-(氟甲氧基)-1H-吡啶-5-甲酰胺(已知于W02008/134969)、[2-(2,4-二氯苯基)-3-氧代-4-氧杂螺[4.5]癸-1-烯-1-基]碳酸丁酯(已知于CN 102060818)、(3E)-3-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-亚吡啶基]-1,1,1-三氟丙-2-酮(已知于W02013/144213)、N-(甲基磺酰基)-6-[2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]吡啶-2-羧酰胺(已知于W02012/000896)、N-[3-(苄基氨基甲酰基)-4-氯苯基]-1-甲基-3-(五

氟乙基)-4-(三氟甲基)-1H-吡啶-5-羧酰胺(已知于W02010/051926)。

[0326] 杀真菌剂

[0327] 本文中以其通用名称说明的活性化合物是已知的,并且记载于例如“农药手册(ThePesticideManual)”或互联网(例如<http://www.alanwood.net/pesticides>)上。

[0328] 如果存在适当的官能团,则(1)至(15)类中所列的所有杀真菌混和组分可任选地与相应的碱或酸形成盐。此外,如果互变异构是可行的,则(1)至(15)类中所列的杀真菌混和组分也包括互变异构形式。

[0329] (1) 麦角固醇生物合成抑制剂,例如(1.01) aldimorph、(1.02) 戊环唑(azaconazole)、(1.03) 双苯三唑醇(bitertanol)、(1.04) 糠菌唑(bromuconazole)、(1.05) 环丙唑醇(cyproconazole)、(1.06) 苄氯三唑醇(diclobutrazole)、(1.07) 苯醚甲环唑(difenoconazole)、(1.08) 烯唑醇(diniconazole)、(1.09) M-烯唑醇(diniconazole-M)、(1.10) 吗菌灵(dodemorph)、(1.11) 吗菌灵乙酸盐(dodemorphacetate)、(1.12) 氟环唑(epoxiconazole)、(1.13) 乙环唑(etaconazole)、(1.14) 氯苯嘧啶醇(fenarimol)、(1.15) 腈苯唑(fenbuconazole)、(1.16) 环酰菌胺(fenhexamid)、(1.17) 苯锈啶(fenpropidin)、(1.18) 丁苯吗啉(fenpropimorph)、(1.19) 喹唑菌酮(fluquinconazole)、(1.20) 调啉醇(flurprimidol)、(1.21) 氟硅唑(flusilazole)、(1.22) 粉唑醇(flutriafol)、(1.23) 呋菌唑(furconazole)、(1.24) 顺呋醚唑(furconazole-cis)、(1.25) 己唑醇(hexaconazole)、(1.26) 烯菌灵(imazalil)、(1.27) 烯菌灵硫酸盐(imazalil sulfate)、(1.28) 酰胺唑(imibenconazole)、(1.29) 环戊唑醇(ipconazole)、(1.30) 叶菌唑(metconazole)、(1.31) 腈菌唑(myclobutanil)、(1.32) 萘替芬(naftifin)、(1.33) 氟苯嘧啶醇(nuarimol)、(1.34) 噁咪唑(oxpoconazole)、(1.35) 多效唑(paclobutrazol)、(1.36) 稻瘟酯(pefurazoate)、(1.37) 戊菌唑(penconazole)、(1.38) 粉病灵(piperalin)、(1.39) 咪鲜胺(prochloraz)、(1.40) 丙环唑(propiconazole)、(1.41) 丙硫菌唑(prothioconazole)、(1.42) 稗草畏(pyributicarb)、(1.43) 啉斑肟(pyrifenoxy)、(1.44) 唑啉菌酮(quinconazole)、(1.45) 硅氟唑(simeconazole)、(1.46) 螺环菌胺(spiroxamine)、(1.47) 戊唑醇(tebuconazole)、(1.48) 特比萘芬(terbinafine)、(1.49) 氟醚唑(tetraconazole)、(1.50) 三唑酮(triadimefon)、(1.51) 唑菌醇(triadimenol)、(1.52) 克啉菌(tridemorph)、(1.53) 氟菌唑(triflumizole)、(1.54) 噻氨灵(triforine)、(1.55) 灭菌唑(triticonazole)、(1.56) 烯效唑(uniconazole)、(1.57) 精烯效唑(uniconazole-P)、(1.58) 烯霜苄唑(viniconazole)、(1.59) 伏立康唑(voriconazole)、(1.60) 1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)环庚醇、(1.61) 1-(2,2-二甲基-2,3-二氢-1H-茛-1-基)-1H-咪唑-5-羧酸甲酯、(1.62) N'-{5-(二氟甲基)-2-甲基-4-[3-(三甲基甲硅烷基)丙氧基]苯基}-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(1.63) N-乙基-N-甲基-N'-{2-甲基-5-(三氟甲基)-4-[3-(三甲基甲硅烷基)丙氧基]苯基}亚氨代甲酰胺、(1.64) 0-[1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁-2-基]-1H-咪唑-1-硫代羧酸酯、(1.65) 啉菌噁唑(pyrisoxazole)、(1.66) 2-[[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.67) 1-[[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基]-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.68) 5-(烯丙基硫基)-1-[[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基]-1H-1,2,4-三唑、(1.69) 2-[1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、

(1.70) 2- {[rel (2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.71) 2- {[rel (2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.72) 1- {[rel (2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.73) 1- {[rel (2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.74) 5-(烯丙基硫基)-1- {[rel (2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(1.75) 5-(烯丙基硫基)-1- {[rel (2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(1.76) 2- [(2S,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.77) 2- [(2R,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.78) 2- [(2R,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.79) 2- [(2S,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.80) 2- [(2S,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.81) 2- [(2R,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.82) 2- [(2R,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.83) 2- [(2S,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.84) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.85) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.86) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)戊-2-醇、(1.87) 2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.88) 2-[2-氯-4-(2,4-二氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.89) (2R)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.90) (2R)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.91) (2S)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.92) (2S)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.93) (1S,2R,5R)-5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇、(1.94) (1R,2S,5S)-5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇、(1.95) 5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇；

[0330] 2) 复合物I或II的呼吸链抑制剂,例如(2.01)联苯吡菌胺(bixafen)、(2.02)啉酰菌胺(boscalid)、(2.03)萎锈灵(carboxin)、(2.04)氟嘧菌胺二氟林(diflumetorim)、(2.05)甲呋酰胺(fenfuram)、(2.06)氟吡菌酰胺(fluopyram)、(2.07)氟酰胺(flutolanil)、(2.08)氟唑菌酰胺(fluxapyroxad)、(2.09)呋吡菌胺(furametpyr)、(2.10)拌种胺(furmecyclox)、(2.11)吡唑萘菌胺(顺式差向异构外消旋体1RS、4SR、9RS和反式差向异构外消旋体1RS、4SR、9SR的混合物)、(2.12)吡唑萘菌胺(反式差向异构外消旋体1RS、4SR、9SR)、(2.13)吡唑萘菌胺(反式差向异构对映异构体1R、4S、9S)、(2.14)吡唑萘菌胺(反式差向异构对映异构体1S、4R、9R)、(2.15)吡唑萘菌胺(顺式差向异构外消旋体1RS、4SR、9RS)、(2.16)吡唑萘菌胺(顺式差向异构对映异构体1R、4S、9R)、(2.17)吡唑萘菌胺(顺式差

向异构对映异构体1S、4R、9S)、(2.18) 灭锈胺(meppronil)、(2.19) 氧化萎锈灵(oxycarboxin)、(2.20) 戊苯吡菌胺(penflufen)、(2.21) 吡噻菌胺(penthiopyrad)、(2.22) 氟唑环菌胺(sedaxane)、(2.23) 噻氟菌胺(thifluzamide)、(2.24) 1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-甲酰胺羧酰胺、(2.25) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-1H-吡唑-4-羧甲酰胺、(2.26) 3-(二氟甲基)-N-[4-氟-2-(1,1,2,3,3,3-六氟丙氧基)苯基]-1-甲基-1H-吡唑-4-羧甲酰胺、(2.27) N-[1-(2,4-二氯苯基)-1-甲氧基丙烷-2-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧甲酰胺、(2.28) 5,8-二氟-N-[2-(2-氟-4-{[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]氧基}苯基)乙基]-喹唑啉-4-胺、(2.29) 苯并烯氟菌唑(benzovindiflupyr)、(2.30) N-[(1S,4R)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-亚甲基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.31) N-[(1R,4S)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-亚甲基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.32) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.33) 1,3,5-三甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.34) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.35) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.36) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.37) 3-(二氟甲基)-1-甲基-1-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.38) 3-(二氟甲基)-1-甲基-1-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.39) 1,3,5-三甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-羧、(2.40) 1,3,5-三甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.41) 麦锈灵(benodanil)、(2.42) 2-氯-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)吡啶-3-羧酰胺、(2.43) isofetamid、(2.44) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[2'-(三氟甲基)联苯基-2-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.45) N-(4'-氯联苯-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.46) N-(2',4'-二氟联苯-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.47) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(三氟甲基)联苯基-2-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.48) N-(2',5'-二氟联苯-2-基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.49) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)联苯基-2-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.50) 5-氟-1,3-二甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)联苯基-2-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.51) 2-氯-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)联苯基-2-基]烟酰胺、(2.52) 3-(二氟甲基)-N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)联苯基-2-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.53) N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)联苯基-2-基]-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.54) 3-(二氟甲基)-N-(4'-乙炔基联苯基-2-基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.55) N-(4'-乙炔基联苯基-2-基)-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.56) 2-氯-N-(4'-乙炔基联苯基-2-基)烟酰胺、(2.57) 2-氯-N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)联苯基-2-基]烟酰胺、(2.58) 4-(二氟甲基)-2-甲基-N-[4'-(三氟甲基)联苯基-2-基]-1,3-噻唑-5-羧酰胺、(2.59) 5-氟-N-[4'-(3-羟基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯基-2-基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.60) 2-氯-N-[4'-(3-羟基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯基-2-基]烟酰胺、(2.61) 3-(二氟甲基)-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯基-2-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.62) 5-氟-N-[4'-(3-甲氧基-

3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯基-2-基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.63) 2-氯-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯基-2-基]烟酰胺、(2.64) 1,3-二甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.65) 1,3-二甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.66) 1,3-二甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.67) 3-(二氟甲基)-N-甲氧基-1-甲基-N-[1-(2,4,6-三氯苯基)丙-2-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.68) 3-(二氟甲基)-N-(7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.69) 3-(二氟甲基)-N-[(3R)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.70) 3-(二氟甲基)-N-[(3S)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺；

[0331] 3) 复合物III的呼吸链抑制剂,例如,(3.01) 唑啉菌胺(ametocetradin)、(3.02) 安美速(amisulbrom)、(3.03) 唑啉酯(azoxystrobin)、(3.04) 氰霜唑(cyazofamid)、(3.05) 甲香菌酯(coumethoxystrobin)、(3.06) 丁香菌酯(coumoxystrobin)、(3.07) 醚菌胺(dimoxystrobin)、(3.08) 烯肟菌酯(enestroburin)、(3.09) 噁唑菌酮(famoxadone)、(3.10) 咪唑菌酮(fenamidone)、(3.11) 氟菌螨酯(flufenoxystrobin)、(3.12) 氟唑菌酯(fluoxastrobin)、(3.13) 醚菌酯(kresoxim-methyl)、(3.14) 苯氧菌胺(metominostrobin)、(3.15) 肟醚菌胺(orysastrobin)、(3.16) 啉氧菌酯(picoxystrobin)、(3.17) 唑菌胺酯(pyraclostrobin)、(3.18) 唑胺菌酯(pyrametostrobin)、(3.19) 唑菌酯(pyraoxystrobin)、(3.20) 吡菌苯威(pyribencarb)、(3.21) 氯啉菌酯(triclopyricarb)、(3.22) 肟菌酯(trifloxystrobin)、(3.23) (2E)-2-(2-[[6-(3-氯-2-甲基苯氧基)-5-氟啉啉-4-基]氧基]苯基)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、(3.24) (2E)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-2-(2-[[{(1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基}氨基]氧基]甲基]苯基)乙酰胺、(3.25) (2E)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-2-{2-[(E)-{(1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基)亚氨基]甲基]苯基}乙酰胺、(3.26) (2E)-2-{2-[[{(1E)-1-(3-[(E)-1-氟-2-苯乙烯基]氧基]苯基)亚乙基}氨基]氧基]甲基]苯基}-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、(3.27) 烯肟菌胺(fenaminstrobin)、(3.28) 5-甲氧基-2-甲基-4-(2-[[{(1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基}氨基]氧基]甲基]苯基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮、(3.29) (2E)-2-{2-[(环丙基[(4-甲氧基苯基)亚氨基]甲基]硫基)甲基]苯基}-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(3.30) N-(3-乙基-3,5,5-三甲基环己基)-3-(甲酰胺基)-2-羟基苯甲酰胺、(3.31) 2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺、(3.32) 2-{2-[(2,5-二甲基-苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺、(3.33) (2E,3Z)-5-[[1-(4-氯苯基)-1H-吡唑-3-基]氧基]-2-(甲氧基亚氨基)-N,3-二甲基戊-3-烯酰胺；

[0332] 4) 有丝分裂和细胞分裂抑制剂,例如(4.01) 苯菌灵(benomyl)、(4.02) 多菌灵(carbendazim)、(4.03) 氯苯咪唑(chlorfenazole)、(4.04) 乙霉威(diethofencarb)、(4.05) 噁唑菌胺(ethaboxam)、(4.06) 氟吡菌胺(fluopicolid)、(4.07) 麦穗宁(fuberidazole)、(4.08) 戊菌隆(pencycuron)、(4.09) 噁苯咪唑(thiabendazole)、(4.10) 甲基硫菌灵(thiophanate-methyl)、(4.11) 硫菌灵(thiophanate)、(4.12) 苯酰菌胺(zoxamide)、(4.13) 5-氯-7-(4-甲基哌啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶、(4.14) 3-氯-5-(6-氯吡啶-3-基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)哒嗪；

[0333] 5) 能够具有多位点作用的化合物,例如,(5.01)波尔多液混合物(bordeaux mixture)、(5.02)敌菌丹(captafol)、(5.03)克菌丹(captan)、(5.04)百菌清(chlorothalonil)、(5.05)氢氧化铜、(5.06)环烷酸铜(coppernaphthenate)、(5.07)氧化铜、(5.08)氧氯化铜(copperoxychloride)、(5.09)硫酸铜(2+)(coppersulfate)、(5.10)抑菌灵(dichlofluanid)、(5.11)二噻农(dithianon)、(5.12)多果定(dodine)、(5.13)多果定游离碱(dodine free base)、(5.14)福美铁(ferbam)、(5.15)氟灭菌丹(fluorofolpet)、(5.16)灭菌丹(folpet)、(5.17)双胍辛盐(guazatine)、(5.18)双胍辛乙酸盐(guazatine acetate)、(5.19)双胍辛胺(iminoctadine)、(5.20)双胍辛胺苯磺酸盐(iminoctadine albesilate)、(5.21)双胍辛胺三乙酸盐(iminoctadine triacetate)、(5.22)代森锰铜(mancopper)、(5.23)代森锰锌(mancozeb)、(5.24)代森锰(maneb)、(5.25)代森联(metiram)、(5.26)代森联锌(metiramzinc)、(5.27)喹啉铜(oxine-copper)、(5.28)丙烷脒(propamidine)、(5.29)甲基代森锌(propineb)、(5.30)硫和硫制剂包括多硫化钙、(5.31)福美双(thiram)、(5.32)对甲抑菌灵(tolylfluanid)、(5.33)代森锌(zineb)、(5.34)福美锌(ziram)、(5.35)敌菌灵(anilazine);

[0334] 6) 能够诱导宿主防御的化合物,例如,(6.01)苯并噻二唑(acibenzolar-S-methyl)、(6.02)异噻菌胺(isotianil)、(6.03)噻菌灵(probenazole)、(6.04)噻酰菌胺(tiadinil)、(6.05)海带多糖(laminarin);

[0335] 7) 氨基酸和蛋白质生物合成抑制剂,例如,(7.01)andoprim、(7.02)灭瘟素(blasticidin-S)、(7.03)环丙嘧啶(cyprodinil)、(7.04)春雷霉素(kasugamycin)、(7.05)春雷霉素盐酸盐水合物(kasugamycin hydrochloride hydrate)、(7.06)噻菌胺(mepanipyrim)、(7.07)噻霉胺(pyrimethanil)、(7.08)3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉、(7.09)土霉素(oxytetracycline)、(7.10)链霉素(streptomycin);

[0336] 8) ATP生成抑制剂,例如,(8.01)薯瘟锡(fentinacetate)、(8.02)三苯基氯化锡(fentinchloride)、(8.03)毒菌锡(fentinhydroxide)、(8.04)噻菌胺(silthiofam);

[0337] 9) 细胞壁合成抑制剂,例如(9.01)苯噻菌胺(benthiavalicarb)、(9.02)烯酰吗啉(dimethomorph)、(9.03)氟吗啉(flumorph)、(9.04)缬霉威(iprovalicarb)、(9.05)双炔酰菌胺(mandipropamid)、(9.06)多抗霉素(polyoxins)、(9.07)保粒霉素(polyoxorim)、(9.08)井冈霉素A(validamycin A)、(9.09)霜霉灭(valifenalate)、(9.10)多氧菌素B(polyoxin B)、(9.11) (2E)-3-(4-叔丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(吗啉-4-基)丙-2-烯-1-酮、(9.12) (2Z)-3-(4-叔丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(吗啉-4-基)丙-2-烯-1-酮;

[0338] (10) 脂质和膜合成抑制剂,例如,(10.01)联苯、(10.02)地茂散(chloroneb)、(10.03)氯硝胺(dicloran)、(10.04)克瘟散(edifenphos)、(10.05)土菌灵(etridiazole)、(10.06)碘代丙炔基丁基甲胺酸酯(iodocarb)、(10.07)异稻瘟净(iprobenfos)、(10.08)稻瘟灵(isoprothiolane)、(10.09)霜霉威(propamocarb)、(10.10)霜霉威盐酸盐(propamocarb hydrochloride)、(10.11)胺丙威(prothiocarb)、(10.12)吡菌磷(pyrazophos)、(10.13)五氯硝基苯(quintozene)、(10.14)四氧硝基苯(tecnazene)、(10.15)甲基立枯磷(tolclofos-methyl);

[0339] 11) 黑色素生物合成抑制剂,例如(11.01)加普胺(carpropamid)、(11.02)双氯氰

菌胺(diclocymet)、(11.03) 稻瘟酰胺(fenoxanil)、(11.04) 四氯苯酞(fthalide)、(11.05) 咯嗪酮(pyroquilon)、(11.06) 三环唑(tricyclazole)、(11.07) 2,2,2-三氟乙基{3-甲基-1-[(4-甲基苯甲酰基) 氨基] 丁烷-2-基} 氨基甲酸酯;

[0340] 12) 核酸合成抑制剂,例如,(12.01) 苯霜灵(benalaxyl)、(12.02) 高效苯霜灵(benalaxyl-M) (kiralaxyl)、(12.03) 磺酸丁嘧啶(bupirimate)、(12.04) clozylacon、(12.05) 甲菌定(dimethirimol)、(12.06) 乙菌定(ethirimol)、(12.07) 呋霜灵(furalaxyl)、(12.08) 噁霉灵(hymexazol)、(12.09) 甲霜灵(metalaxyl)、(12.10) 高效甲霜灵(metalaxyl-M) (精甲霜灵(mefenoxam))、(12.11) 甲呋酰胺(ofurace)、(12.12) 噁霜灵(oxadixyl)、(12.13) 噁喹酸(oxolinicacid)、(12.14) 辛噻酮(octhilinone);

[0341] 13) 信号转导抑制剂,例如,(13.01) 乙菌利(chlozolate)、(13.02) 拌种咯(fenpiclonil)、(13.03) 咯菌腈(fludioxonil)、(13.04) 异菌脲(iprodione)、(13.05) 腐霉利(procymidone)、(13.06) 喹氧灵(quinoxifen)、(13.07) 乙烯菌核利(vinclozolin)、(13.08) 丙氧喹啉(proquinazid);

[0342] 14) 能够用作解偶联剂的化合物,例如,(14.01) 乐杀螨(binapacryl)、(14.02) 敌螨普(dinocap)、(14.03) 噻菌脲(ferimzone)、(14.04) 氟啶胺(fluzinam)、(14.05) 消螨多(meptyldinocap);

[0343] 15) 其他化合物,例如,(15.001) 苯噻硫氰(benthiazole)、(15.002) bethoxazine、(15.003) 卡巴西霉素(capsimycin)、(15.004) 香芹酮(carvone)、(15.005) 灭螨猛(chinomethionat)、(15.006) 甲氧苯啉菌(pyriofenone) (氯芬酮(chlazafenone))、(15.007) 硫杂灵(cufraneb)、(15.008) 环氟菌胺(cyflufenamid)、(15.009) 霜脲氰(cymoxanil)、(15.010) 环丙磺酰胺(cyprosulfamide)、(15.011) 棉隆原粉(dazomet)、(15.012) 咪菌威(debacarb)、(15.013) 双氯酚(dichlorophen)、(15.014) 吡菌酮(diclomezine)、(15.015) 野燕枯(difenzoquat)、(15.016) 野燕枯甲基硫酸盐(difenzoquat metilsulphate)、(15.017) 二苯胺(diphenylamine)、(15.018) ecomate、(15.019) 胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)、(15.020) flumetover、(15.021) 唑呋草(fluorimide)、(15.022) 磺菌胺(flusulfamide)、(15.023) 氟噻菌灵(flutianil)、(15.024) 乙膦酸铝(fosetyl-aluminium)、(15.025) 乙膦酸钙(fosetyl-calcium)、(15.026) 乙膦酸钠(fosetyl-sodium)、(15.027) 六氯苯(hexachlorobenzene)、(15.028) 人间霉素(irumamycin)、(15.029) 磺菌威(methasulfocarb)、(15.030) 异硫氰酸甲酯(methylisothiocyanate)、(15.031) 苯菌酮(metrafenone)、(15.032) 灭粉霉素(mildiomycin)、(15.033) 游霉素(natamycin)、(15.034) 二甲基二硫代氨基甲酸镍(nickel dimethyldithiocarbamate)、(15.035) 酞菌酯(nitrothal-isopropyl)、(15.036) oxamocarb、(15.037) 奥施康定(oxyfenthiin)、(15.038) 五氯苯酚(pentachlorophenol) 及其盐、(15.039) 苯醚菊酯(phenothrin)、(15.040) 磷酸及其盐、(15.041) 霜霉威-乙膦酸盐(propamocarb-fosetate)、(15.042) propanosine-钠、(15.043) 丁吡吗啉(pyrimorph)、(15.044) 吡咯尼林(pyrrolnitrin)、(15.045) 特弗喹啉(tebufloquin)、(15.046) 叶枯酞(tecloftalam)、(15.047) 甲磺菌胺(tolnifanide)、(15.048) 咪唑嗪(triazoxide)、(15.049) 水杨菌胺(trichlamide)、(15.050) 氰菌胺(zarilamid)、(15.051) (3S,6S,7R,8R)-8-苄基-3-[(3-[(异丁酰氧基) 甲氧基]-4-甲氧基吡啶-2-基) 羰基] 氨基]-6-甲基-4,

9-二氧代-1,5-二氧杂壬烷-7-基-2-甲基丙酸酯、(15.052) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(15.053) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(15.054) oxathiapiproline、(15.055) 1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁烷-2-基-1H-咪唑-1-羧酸酯、(15.056) 2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺酰基)吡啶、(15.057) 2,3-二丁基-6-氯噻吩并[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮、(15.058) 2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二噻英并[2,3-c:5,6-c']二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮、(15.059) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[(5R)-5-苯基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)乙酮、(15.060) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[(5S)-5-苯基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)乙酮、(15.061) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-{4-[4-(5-苯基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基)-1,3-噻唑-2-基]哌啶-1-基}乙酮、(15.062) 2-丁氧基-6-碘代-3-丙基-4H-苯并吡喃-4-酮、(15.063) 2-氯-5-[2-氯-1-(2,6-二氟-4-甲氧基苯基)-4-甲基-1H-咪唑-5-基]吡啶、(15.064) 2-苯基苯酚及盐、(15.065) 3-(4,4,5-三氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉、(15.066) 3,4,5-三氯吡啶-2,6-二甲腈、(15.067) 3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基吡嗪、(15.068) 4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基吡嗪、(15.069) 5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇、(15.070) 5-氯-N'-苯基-N'-(丙-2-炔-1-基)噻吩-2-磺酰肼、(15.071) 5-氟-2-[(4-氟苄基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.072) 5-氟-2-[(4-甲基苄基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.073) 5-甲基-6-辛基[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-7-胺、(15.074) (2Z)-3-氨基-2-氰基-3-苯基丙烯酸乙酯、(15.075) N'-(4-{[3-(4-氯苄基)-1,2,4-噻二唑-5-基]氧基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.076) N-(4-氯苄基)-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]丙酰胺、(15.077) N-[(4-氯苯基)(氰基)甲基]-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]丙酰胺、(15.078) N-[(5-溴-3-氯吡啶-2-基)甲基]-2,4-二氯烟酰胺、(15.079) N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯烟酰胺、(15.080) N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2-氟-4-碘烟酰胺、(15.081) N-{(E)-[(环丙基甲氧基)亚氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苯基乙酰胺、(15.082) N-{(Z)-[(环丙基甲氧基)亚氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苯基乙酰胺、(15.083) N'-{4-[(3-叔丁基-4-氰基-1,2-噻唑-5-基)氧基]-2-氯-5-甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.084) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-(1,2,3,4-四氢萘-1-基)-1,3-噻唑-4-甲酰胺、(15.085) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-[(1R)-1,2,3,4-四氢萘-1-基]-1,3-噻唑-4-羧酰胺、(15.086) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-[(1S)-1,2,3,4-四氢萘-1-基]-1,3-噻唑-4-羧酰胺、(15.087) {6-[(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基}氧基]甲基]吡啶-2-基}氨基甲酸戊酯、(15.088) 吩嗪-1-羧酸、(15.089) 喹啉-8-醇、(15.090) 喹啉-8-醇硫酸盐(2:1)、(15.091) {6-[(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基}氧基]甲基]吡啶-2-基}氨基甲酸叔丁酯、(15.092) (5-溴-2-甲氧基-4-甲基吡啶-3-基)(2,3,4-三甲氧基-6-甲基苯基)甲酮、(15.093) N-[2-(4-{[3-(4-氯苯基)丙-2-炔-1-基]氧基}-3-甲氧基苯基)乙基]-N2-(甲基磺酰基)缬氨酰胺、(15.094) 4-氧代-4-

[(2-苯基乙基) 氨基] 丁酸、(15.095) {6-[((Z)-(1-甲基-1H-四唑-5-基) (苯基) 亚甲基) 氨基] 氧基} 甲基吡啶-2-基} 氨基甲酸丁-3-炔-1-基酯、(15.096) 4-氨基-5-氟嘧啶-2-醇 (互变异构形式: 4-氨基-5-氟嘧啶-2 (1H)-酮)、(15.097) 3,4,5-三羟基苯甲酸丙酯、(15.098) [3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基] (吡啶-3-基) 甲醇、(15.099) (S)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基] (吡啶-3-基) 甲醇、(15.100) (R)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基] (吡啶-3-基) 甲醇、(15.101) 2-氟-6-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基) 苯甲酰胺、(15.102) 2-(6-苄基吡啶-2-基) 喹唑啉、(15.103) 2-[6-(3-氟-4-甲氧基苯基)-5-甲基吡啶-2-基] 喹唑啉、(15.104) 3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基) 喹啉、(15.105) 脱落酸 (abscisic acid)、(15.106) N'-[5-溴-6-(2,3-二氢-1H-茛-2-基氧基)-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.107) N'-{5-溴-6-[1-(3,5-二氟苯基) 乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(15.108) N'-{5-溴-6-[(1R)-1-(3,5-二氟苯基) 乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.109) N'-{5-溴-6-[(1S)-1-(3,5-二氟苯基) 乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.110) N'-{5-溴-6-[(顺式-4-异丙基环己基) 氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.111) N'-{5-溴-6-[(反式-4-异丙基环己基) 氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.112) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.113) N-环丙基-N-(2-环丙基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.114) N-(2-叔丁基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.115) N-(5-氯-2-乙基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.116) N-(5-氯-2-异丙基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.117) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-氟苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.118) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(5-氟-2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.119) N-环丙基-N-(2-环丙基-5-氟苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.120) N-(2-环戊基-5-氟苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.121) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-氟-6-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.122) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.123) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基-5-甲基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.124) N-环丙基-N-(2-环丙基-5-甲基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.125) N-(2-叔丁基-5-甲基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.126) N-[5-氯-2-(三氟甲基) 苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.127) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-N-[5-甲基-2-(三氟甲基) 苄基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.128) N-[2-氯-6-(三氟甲基) 苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.129) N-[3-氯-2-氟-6-(三氟甲基) 苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.130) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-4,5-二甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.131) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-硫代甲酰胺、(15.132) N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.133) N'-

{4-[(4,5-二氯-1,3-噻唑-2-基) 氧基]-2,5-二甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.134) N-(4-氯-2,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.135) 9-氟-2,2-二甲基-5-(喹啉-3-基)-2,3-二氢-1,4-苯并氧杂吡庚因、(15.136) 2-{2-氟-6-[(8-氟-2-甲基喹啉-3-基) 氧基] 苯基} 丙-2-醇、(15.137) 2-{2-[(7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基) 氧基]-6-氟苯基} 丙-2-醇、(15.138) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.139) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.140) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.141) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.142) N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.143) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.144) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.145) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.146) N-(2-溴苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.147) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.148) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.149) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.150) N'-(4-{3-[(二氟甲基) 硫烷基]-苯氧基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.151) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(1,1,2,2-四氟乙基) 硫烷基] 苯氧基} 苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.152) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(2,2,2-三氟乙基) 硫烷基] 苯氧基} 苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.153) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(2,2,3,3-四氟丙基) 硫烷基] 苯氧基} 苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.154) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(五氟乙基) 硫烷基] 苯氧基} 苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.155) N'-(4-{[3-(二氟甲氧基) 苯基] 硫烷基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.156) N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(1,1,2,2-四氟乙氧基) 苯基] 硫基} 苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.157) N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(2,2,2-三氟乙氧基) 苯基] 硫基} 苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.158) N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(2,2,3,3-四氟丙氧基) 苯基] 硫基} 苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.159) N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(五氟乙氧基) 苯基] 硫基} 苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、(15.160) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基) 苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基) 哌啶-1-基] 乙酮、(15.161) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基) 苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基) 哌啶-1-基] 乙酮、(15.162) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基) 苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基) 哌啶-1-基] 乙酮、(15.163) 2-{3-[2-(1-{[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基] 乙酰基} 哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基} 苯基甲烷磺酸酯、(15.164) 2-{3-[2-(1-{[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基] 乙酰基} 哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基}-3-氯苯基甲烷磺酸酯、(15.165) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基) 苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基) 哌啶-1-基] 乙酮、(15.166) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基) 苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基) 哌啶-1-基] 乙酮、

(15.167) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.168) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.169) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.170) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.171) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基}苯基甲烷磺酸酯、(15.172) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基}苯基甲烷磺酸酯、(15.173) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基}-3-氯苯基甲烷磺酸酯、(15.174) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基}-3-氯苯基甲烷磺酸酯。

[0344] 作为混合组分的生物农药

[0345] 式(I)的化合物可与生物农药结合。

[0346] 生物农药尤其包括细菌、真菌、酵母菌、植物提取物和由微生物产生的包括蛋白质和次级代谢产物在内的产物。

[0347] 生物农药包括细菌,例如,形成孢子的细菌、根定殖细菌以及起生物杀昆虫剂、杀真菌剂或杀线虫剂作用的细菌。

[0348] 用作或可用作生物农药的这类细菌的实例为:

[0349] 解淀粉芽孢杆菌(*Bacillus amyloliquefaciens*),菌株FZB42(DSM 231179);或蜡状芽孢杆菌(*Bacillus cereus*),尤其是蜡状芽孢杆菌菌株CNCMI-1562;或者坚强芽孢杆菌(*Bacillus firmus*),菌株I-1582(登录号CNCMI-1582);或短小芽孢杆菌(*Bacillus pumilus*),尤其是菌株GB34(登录号ATCC700814)和菌株QST2808(登录号NRRLB-30087);或枯草芽孢杆菌(*Bacillus subtilis*),尤其是菌株GB03(登录号ATCCSD-1397)或枯草芽孢杆菌菌株QST713(登录号NRRLB-21661)或枯草芽孢杆菌菌株OST 30002(登录号NRRLB-50421);苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*),尤其是苏云金芽孢杆菌以色列亚种(血清型H-14),菌株AM65-52(登录号ATCC1276),或苏云金芽孢杆菌鲑泽亚种,尤其是菌株ABTS-1857(SD-1372),或苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种菌株HD-1,或苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种菌株NB 176(SD-5428);侵入巴斯德氏芽菌(*Pasteuria penetrans*),巴斯德氏芽菌属种(*Pasteuria* spp.) (肾形肾状线虫(*Rotylenchulus reniformis* nematode))-PR3(登录号ATCCSD-5834);细黄链霉菌(*Streptomyces microflavus*)菌株AQ6121(=QRD31.013,NRRLB-50550);鲜黄链霉菌(*Streptomyces galbus*)菌株AQ6047(登录号NRRL 30232)。

[0350] 用作或可用作生物农药的真菌和酵母菌的实例为:

[0351] 球孢白僵菌(*Beauveria bassiana*),特别是菌株ATCC74040;盾壳霉(*Coniothyrium minitans*),特别是菌株CON/M/91-8(登录号DSM-9660);刀孢蜡蚧菌属种

(*Lecanicillium* spp.), 特别是菌株 HRO LEC12; 蜡蚧霉 (*Lecanicillium lecanii*), (原名为蜡蚧轮枝菌 (*Verticillium lecanii*)), 特别是菌株 KV01; 绿僵菌 (*Metarhizium anisopliae*), 特别是菌株 F52 (DSM3884/ATCC90448); 梅奇酵母菌 (*Metschnikowia fructicola*), 特别是菌株 NRRL Y-30752; 玫烟色拟青霉 (*Paecilomyces fumosoroseus*) (现名: 玫烟色棒束孢 (*Isaria fumosorosea*)), 特别是菌株 IFPC 200613, 或菌株 Apopka 97 (登录号 ATCC 20874); 淡紫拟青霉 (*Paecilomyces lilacinus*), 特别是淡紫拟青霉菌株 251 (AGAL 89/030550); 黄色蠕形霉 (*Talaromyces flavus*), 特别是菌株 V117b; 深绿木霉 (*Trichoderma atroviride*), 特别是菌株 SC1 (登录号 CBS 122089); 哈茨木霉 (*Trichoderma harzianum*), 特别是哈茨木霉 (*T. harzianum* rifai) T39 (登录号 CNCMI-952)。

[0352] 用作或可用作生物农药的病毒的实例为:

[0353] 棉褐带卷蛾 (*Adoxophyes orana*) (夏季水果卷叶蛾 (summer fruit tortrix)) 颗粒体病毒 (GV)、苹果小卷蛾 (*Cydia pomonella*) (苹果蠹蛾 (codling moth)) 颗粒体病毒 (GV)、棉铃虫 (*Helicoverpa armigera*) (棉铃虫 (cotton bollworm)) 核型多角体病毒 (NPV)、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua*) (甜菜夜蛾 (beet armyworm)) mNPV、草地贪夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*) (草地粘虫 (fall armyworm)) mNPV、海灰翅夜蛾 (*Spodoptera littoralis*) (非洲棉树叶虫 (African cotton leafworm)) NPV。

[0354] 还包括作为“接种剂”加入植物或植物部位或植物器官并借助其特殊的性质来促进植物生长和植物健康的细菌和真菌。可提及的实例为:

[0355] 土壤杆菌属种 (*Agrobacterium* spp.); 固氮根瘤菌 (*Azorhizobium caulinodans*); 固氮螺菌属种 (*Azospirillum* spp.); 固氮菌属种 (*Azotobacter* spp.); 短根瘤菌属种 (*Bradyrhizobium* spp.); 伯克霍尔德菌属种 (*Burkholderia* spp.), 尤其是洋葱伯克霍尔德菌 (*Burkholderia cepacia*) (原名为洋葱假单胞菌 (*Pseudomonas cepacia*)); 巨孢囊霉属种 (*Gigaspora* spp.); 或单孢巨孢囊霉属种 (*Gigaspora monosporum*); 球囊霉属种 (*Glomus* spp.); 蜡蘑属种 (*Laccaria* spp.); 布氏乳杆菌 (*Lactobacillus buchneri*); 类球囊霉属种 (*Paraglomus* spp.); 彩色豆马勃 (*Pisolithus tinctorus*); 假单胞菌属种 (*Pseudomonas* spp.); 根瘤菌属种 (*Rhizobium* spp.), 尤其是三叶草根瘤菌 (*Rhizobium trifolii*); 须腹菌属种 (*Rhizopogon* spp.); 硬皮马勃属种 (*Scleroderma* spp.); 乳牛杆菌属种 (*Suillus* spp.); 链霉菌属种 (*Streptomyces* spp.)。

[0356] 用作或可用作生物农药的植物提取物和由微生物产生的包括蛋白质和次级代谢产物在内的产物的实例为:

[0357] 大蒜 (*Allium sativum*)、苦艾 (*Artemisia absinthium*)、印楝素 (azadirachtin)、Biokeeper WP、Cassia nigricans、苦皮藤 (*Celastrus angulatus*)、美洲土荆芥 (*Chenopodium anthelminticum*)、几丁质 (chitin)、Armour-Zen、欧洲鳞毛蕨 (*Dryopteris filix-mas*)、问荆 (*Equisetum arvense*)、Fortune Aza、Fungastop、Heads Up (奎藜籽皂甙 (*Chenopodium quinoa saponin*) 提取物)、除虫菊/除虫菊素 (pyrethrum/pyrethrins)、苏里南苦树 (*Quassia amara*)、栎属 (*Quercus*)、皂树 (*Quillaja*)、Regalia、“Requiem™ 杀昆虫剂”、鱼藤酮 (rotenone)、鱼尼丁 (ryania)/兰尼碱 (ryanodine)、聚合草 (*Symphytum officinale*)、艾菊 (*Tanacetum vulgare*)、麝香草酚 (thymol)、Triact 70、TriCon、大金莲花 (*Tropaeolum majus*)、大荨麻 (*Urtica dioica*)、藜芦定 (Veratrin)、白槲寄生 (*Viscum*

album)、十字花科(Brassicaceae)提取物,尤其是油菜籽粉或芥末粉。

[0358] 作为混合组分的安全剂

[0359] 式(I)的化合物可与安全剂结合,所述安全剂为例如解草酮(benoxacor)、解毒唑(cloquintocet(-mexyl))、解草胺腈(cyometrinil)、环丙磺酰胺(cyprosulfamide)、二氯丙烯胺(dichlormid)、解草唑(fenchlorazole(-ethyl))、解草啉(fenclorim)、解草安(flurazole)、氟草肟(fluxofenim)、解草噁唑(furilazole)、双苯噁唑酸(isoxadifen(-ethyl))、吡唑解草酯(mefenpyr(-diethyl))、萘二甲酸酐(naphthalic anhydride)、解草腈(oxabetrinil)、2-甲氧基-N-{4-[(甲基氨基甲酰基)氨基]苯基}磺酰基)苯甲酰胺(CAS129531-12-0)、4-(二氯乙酰基)-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷(CAS71526-07-3)、2,2,5-三甲基-3-(二氯乙酰基)-1,3-噁唑烷(CAS52836-31-4)。

[0360] 植物和植物部位

[0361] 可根据本发明处理所有的植物和植物部位。在本文中,植物理解为意指所有的植物和植物种群,例如期望和不期望的野生植物或作物植物(包括天然存在的作物植物),例如谷类(小麦、稻、黑小麦、大麦、黑麦、燕麦)、玉米、大豆、马铃薯、甜菜、甘蔗、番茄、豌豆和其他蔬菜种类、棉花、烟草、油菜以及果实植物(具有下述果实:苹果、梨、柑橘类果实和葡萄)。作物植物可为可通过常规育种和优化方法或者通过生物技术和基因工程方法或这些方法的组合获得的植物,包括转基因植物且包括受植物育种者的权利保护或不受其保护的植物栽培种。植物部位应当理解为意指植物的地上和地下的所有部位和器官,如芽、叶、花和根,实例为叶、针叶、茎、干、花、子实体、果实和种子,以及根、块茎和根茎。植物部位还包括采收的材料以及无性和有性繁殖的材料,例如插枝、块茎、根茎、幼枝(slip)和种子。

[0362] 根据本发明,使用式(I)的化合物来处理植物和植物部位通过常规处理方法直接进行或使所述化合物作用于其环境、生境或储存空间来进行,所述常规处理方法为例如浸渍、喷雾、蒸发、雾化、散布、涂抹、注射,并且在繁殖材料的情况下,特别是在种子的情况下,还可施用一层或更多层包衣来进行。

[0363] 如上所述,可根据本发明处理所有的植物及其部位。在一个优选的实施方案中,处理野生植物物种和植物栽培种或通过常规生物育种法(如杂交或原生质体融合)获得的那些植物及其部位。在另一个优选的实施方案中,处理通过基因工程方法——如果合适,与常规方法结合——获得的转基因植物和植物栽培种(遗传修饰生物体)及其部位。术语“部位”或“植物的部位”或“植物部位”已在上文作出解释。根据本发明,特别优选处理各市售的常规植物栽培种的植物或使用中的那些植物。植物栽培种理解为意指具有新特性(“性状”)的植物,并且其已通过常规育种、通过突变或通过重组DNA技术生长。它们可以是栽培种、变种、生物型或基因型。

[0364] 转基因植物、种子处理和整合株系(integration event)

[0365] 待根据本发明处理的优选的转基因植物或植物栽培种(通过遗传工程获得的那些)包括通过遗传修饰接受遗传物质的所有植物,该遗传物质赋予这些植物特别有利的、有用的特性(“性状”)。这些特性的实例为:更好的植物生长、对高温或低温提高的耐受性、对干旱或对水或土壤盐度水平提高的耐受性、增强的开花性能、更容易采收、加速成熟、更高的采收率、采收产物更高的品质和/或更高的营养价值、采收产物更好的储存期限和/或更好的加工性。这些特性的其他和特别强调的实例为植物对动物和微生物害虫(例如昆虫、蛛

形纲动物、线虫、螨、蛞蝓和蜗牛) 提高的抗性, 这是由于例如在植物中形成毒素、特别是通过来自苏云金芽孢杆菌的遗传物质(例如通过基因CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9cCry2Ab、Cry3Bb和CryIF及其组合) 在植物中产生的那些毒素; 以及植物对植物病原性真菌、细菌和/或病毒提高的抗性, 这是例如由系统获得性抗性(SAR)、系统素、植物抗毒素、诱导子和抗性基因以及相应的表达蛋白和毒素引起; 以及植物对某些除草活性化合物(例如咪唑啉酮类、磺酰脲类、草甘膦或草丁膦) 提高的耐受性(例如“PAT”基因)。赋予所述期望特性(“形状”) 的基因还可在转基因植物中以彼此结合的方式存在。转基因植物的实例包括重要的作物植物, 例如谷类(小麦、稻、黑小麦、大麦、黑麦、燕麦)、玉米、大豆、马铃薯、甜菜、甘蔗、番茄、豌豆和其他种类的蔬菜、棉花、烟草、油菜以及果实植物(具有下述果实: 苹果、梨、柑橘类果实和葡萄), 特别强调的是玉米、大豆、小麦、稻、马铃薯、棉花、甘蔗、烟草和油菜。特别强调的特性(“性状”) 是植物对昆虫、蛛形纲动物、线虫以及蛞蝓和蜗牛提高的抗性。

[0366] 作物保护——处理的类型

[0367] 植物和植物部位是用式(I) 的化合物来直接处理, 或通过作用于其环境、生境或储存空间来进行处理, 所述处理采用常规处理方法, 例如通过浸渍、喷雾、雾化、灌溉、蒸发、撒粉、雾化、弥雾、发泡、涂抹、铺展、注射、浇水(浸透)、滴灌, 并且在繁殖材料的情况下、特别是在种子的情况下, 还通过干燥种子处理、液体种子处理、浆料处理, 通过形成包壳(incrusting), 通过用一层或多层包衣包覆等。此外, 可以通过超低容量法施用式(I) 的化合物, 或者将所述施用形式或式(I) 的化合物本身注入到土壤中。

[0368] 优选的对植物的直接处理为叶面施用, 即将式(I) 的化合物施用到叶子上, 其中处理频率和施用率应根据所讨论的害虫的侵染水平来调整。

[0369] 在内吸活性化合物的情况下, 式(I) 的化合物还通过根系进入植物。然后, 通过将式(I) 的化合物作用于植物的生境来处理该植物。这可以例如通过下述方式来完成: 浸透; 或混入土壤或营养液中, 这意指用式(I) 的化合物的液体形式浸渍植物的位置(例如土壤或水培系统); 或土壤施用, 这意指将式(I) 的化合物以固体形式(例如以颗粒的形式) 引入到植物的位置。在水稻作物的情况下, 这还可以通过将式(I) 的化合物以固体施用的形式(例如作为颗粒) 计量加入到淹没的稻田中来完成。

[0370] 种子处理

[0371] 通过处理植物种子来防治动物害虫早已知晓并且是不断改进的主题。然而, 种子处理涉及一系列总是不能以令人满意的方式解决的问题。因此, 需要开发保护种子和发芽植物的方法, 所述方法在储存过程中、在播种后或在植物出苗后无需或至少显著降低额外的农药施用。还需要优化活性化合物的用量, 从而为种子和发芽植物提供最佳的保护以免受动物害虫的侵袭, 而所使用的活性化合物不会损害植物本身。特别地, 处理种子的方法还应考虑抗虫或耐虫的转基因植物所固有的杀昆虫和/或杀线虫特性, 以便使用最少的农药消耗实现对种子和发芽植物的最佳保护。

[0372] 因此, 本发明还特别涉及一种通过用式(I) 的化合物之一处理种子来保护种子和发芽植物免受害虫侵袭的方法。本发明的用于保护种子和发芽植物免受害虫侵袭的方法还包括这样的方法: 其中在一此操作中同时或依序用式(I) 的化合物和混合组分处理种子。其还包括其中在不同的时间用式(I) 的化合物和混合组分处理种子的方法。

[0373] 本发明还涉及式 (I) 的化合物用于处理种子以保护种子和所得植物免受动物害虫侵袭的用途。

[0374] 本发明还涉及已用式 (I) 的化合物处理以保护其免受动物害虫侵袭的种子。本发明还涉及已同时用式 (I) 的化合物和混合组分处理的种子。本发明还涉及已在不同时间用式 (I) 的化合物和混合组分处理的种子。在已在不同时间用式 (I) 的化合物和混合组分处理的种子的情况下,各种物质可存在于种子的不同层中。在这种情况下,包含式 (I) 的化合物和混合组分的层可以任选地被中间层隔开。本发明还涉及这样的种子:其中已经施用式 (I) 的化合物和混合组分作为包衣的一部分或作为除包衣之外的其他一层或其他多层。

[0375] 本发明还涉及这样的种子:其在用式 (I) 的化合物处理后,对其进行薄膜包覆处理以防止灰尘对种子的磨损。

[0376] 内吸作用的式 (I) 化合物的优点之一在于以下事实:通过处理种子,不仅保护种子本身,还保护由其得到的植物在出苗后免受动物害虫的侵袭。以这种方式,可无需在播种时或在播种后对作物立即进行处理。

[0377] 另一个优点在于,用式 (I) 的化合物处理种子可促进经处理的种子的发芽和出苗。

[0378] 同样认为有利的是,式 (I) 的化合物还可尤其用于转基因种子。

[0379] 此外,式 (I) 的化合物还可与信号技术组合物结合使用,从而使得通过共生体(例如根瘤菌、菌根和/或植物内生细菌或真菌)而更好地定殖和/或优化固氮作用。

[0380] 式 (I) 的化合物适合于保护在农业、温室、林业或园艺中使用的任何植物品种的种子。更具体地,所述种子包括下列植物的种子:谷类(例如小麦、大麦、黑麦、粟和燕麦)、玉米、棉花、大豆、稻、马铃薯、向日葵、咖啡、烟草、芸苔(canola)、油菜、甜菜(例如糖用甜菜和饲用甜菜)、花生、蔬菜(例如番茄、黄瓜、菜豆、十字花科蔬菜、洋葱和生菜)、果实植物、草坪植物和观赏性植物。特别重要的是处理谷类(例如小麦、大麦、黑麦和燕麦)、玉米、大豆、棉花、芸苔、油菜和稻的种子。

[0381] 如上所述,用式 (I) 的化合物处理转基因种子也是特别重要的。这涉及通常包含至少一种异源基因的植物的种子,所述异源基因控制特别是具有杀昆虫和/或杀线虫特性的多肽的表达。在此情况下,转基因种子中的异源基因可源自下列微生物:例如,芽孢杆菌属(Bacillus)、根瘤菌属(Rhizobium)、假单孢菌属(Pseudomonas)、沙雷氏菌属(Serratia)、木霉属(Trichoderma)、棒形杆菌属(Clavibacter)、球囊霉属(Glomus)或粘帚霉属(Gliocladium)。本发明特别适合于处理包含至少一种源自芽孢杆菌属种(Bacillus sp)的异源基因的转基因种子。所述异源基因更优选源自苏云金芽孢杆菌。

[0382] 在本发明的上下文中,将式 (I) 的化合物施用于种子。优选在这样的状态下处理种子:其足够稳定以使得在处理过程中不发生损害。通常,可在采收和播种之间的任意时间处理种子。通常使用已从植物分离并且已除去穗轴、外壳、茎、表皮、毛或果肉的种子。例如,可使用已采收、清洁并干燥至允许贮存的水分含水量的种子。或者,也可使用在干燥之后用例如再经水处理,然后再经干燥(例如涂底灌注(priming))的种子。在稻的种子的情况下,也可以使用例如已经在水中吸胀至特定某一阶段(胚乳期(pigeon breast stage))的种子,这导致改善了发芽情况和并使出苗更均匀の出苗。

[0383] 在处理种子时,通常必须注意选择施用于种子的式 (I) 的化合物的量和/或其他添加剂的量,以使种子的发芽不会受到不利的影响或所得植物不会受到损害。在以特定施用

率下可表现出植物毒性作用的活性化合物的情况下,必须特别确保这一点。

[0384] 通常,将式(I)的化合物以合适的制剂的形式施用至种子。用于种子处理的合适的制剂和方法是本领域技术人员已知的。

[0385] 可将式(I)的化合物转化为常规的拌种制剂,例如溶液剂、乳剂、悬液剂、粉剂、泡沫剂、浆剂或其他的种子包衣组合物,以及ULV制剂。

[0386] 这些制剂以已知的方式通过将式(I)的化合物与常规添加剂混合而制备,所述添加剂例如常规的增量剂以及溶剂或稀释剂、染料、湿润剂、分散剂、乳化剂、消泡剂、防腐剂、二次增稠剂、胶粘剂、赤霉素以及水。

[0387] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的染料为通常用于所述目的的所有染料。可以使用微溶于水的颜料,或者可溶于水的染料。实例包括已知名称为罗丹明B、C.I. 颜料红112和C.I. 溶剂红1的染料。

[0388] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的有用的润湿剂为促进润湿并且通常用于活性农用化学化合物制剂的所有物质。优选使用萘磺酸烷基酯,例如萘磺酸二异丙酯或萘磺酸二异丁酯。

[0389] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的合适的分散剂和/或乳化剂为通常用于活性农用化学化合物制剂的所有非离子、阴离子和阳离子分散剂。优选使用非离子或阴离子分散剂,或者非离子或阴离子分散剂的混合物。合适的非离子分散剂特别包括环氧乙烷/环氧丙烷嵌段共聚物、烷基酚聚乙二醇醚和三苯乙基酚聚乙二醇醚,以及其磷酸化或硫酸化衍生物。合适的阴离子分散剂尤其是木素磺酸盐、聚丙烯酸盐和芳基磺酸盐/甲醛缩合物。

[0390] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的消泡剂为通常用于活性农用化学化合物制剂中的所有抑制泡沫的物质。可优选使用硅酮消泡剂和硬脂酸镁。

[0391] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的防腐剂为在农用化学组合物中可用于此目的的所有物质。实例包括双氯酚和苧醇半缩甲醛。

[0392] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的二次增稠剂为在农用化学组合物中可用于此目的的所有物质。优选的实例包括纤维素衍生物、丙烯酸衍生物、黄原胶、改性粘土和细分散的二氧化硅。

[0393] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的有用的粘着剂为可用于拌种产品中的所有常规粘结剂。优选的实例包括聚乙烯吡咯烷酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇和纤基乙酸钠(tylose)。

[0394] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的赤霉素优选为赤霉素A1、A3(=赤霉酸)、A4和A7;特别优选使用赤霉酸。赤霉素是已知的(参见R. Wegle, "Chemie der Pflanzenschutz-und **Schädlingsbekämpfungsmittel**", 第2卷, Springer Verlag, 1970, 第401-412页)。

[0395] 可根据本发明使用的拌种制剂可以直接或在预先用水稀释后用于处理各种不同种类的种子。例如,可使用浓缩剂或通过用水稀释而由其得到的制剂来拌种下列种子:谷类(如小麦、大麦、黑麦、燕麦和黑小麦)的种子,以及玉米、稻、油菜、豌豆、菜豆、棉花、向日葵、大豆和甜菜的种子,或各种不同的蔬菜种子。可根据本发明使用的拌种制剂或其稀释使用形式还可用于转基因植物的拌种。

[0396] 对于用可根据本发明使用的拌种制剂或由其制备的使用形式处理种子而言,所有可常用于拌种的混合装置均为可用的。更具体地,拌种的过程为:将种子以分批或连续操作的方式置于混合器中,加入特定所需量的拌种制剂(以其本身或预先用水稀释之后),并混合直到制剂均匀分布在种子上。如果合适,随后进行干燥操作。

[0397] 可根据本发明使用的拌种制剂的施用率可在相对宽的范围内变化。其取决于该制剂中式(I)的化合物的具体含量和种子。式(I)的化合物的施用率通常为0.001至50g/Kg种子,优选0.01至15g/Kg种子。

[0398] 动物健康

[0399] 在动物健康领域中,即在兽医学领域中,式(I)的化合物对动物寄生虫、特别是外寄生虫或内寄生虫有活性。术语“内寄生虫”尤其包括蠕虫纲和原生动物,例如球虫目。外寄生虫通常且优选为节肢动物,尤其为昆虫和螨类。

[0400] 在兽医学领域中,具有有利的温生物毒性的式(I)的化合物适合于防治在家畜、育种动物、动物园动物、实验室动物、实验动物和家养动物的动物育种和动物饲养中出现的寄生虫。它们对寄生虫发育的所有阶段或特定阶段有活性。

[0401] 农业家畜包括,例如,哺乳动物,如绵羊、山羊、马、驴、骆驼、水牛、兔、驯鹿、扁角鹿,且特别是牛和猪;家禽,如火鸡、鸭、鹅,且特别是鸡;例如在水产养殖中的鱼和甲壳类动物;以及昆虫,如蜜蜂。

[0402] 家养动物包括,例如,哺乳动物,如仓鼠、豚鼠、大鼠、小鼠、毛丝鼠、雪貂,且特别是狗、猫;笼鸟;爬行动物;两栖动物和观赏鱼。

[0403] 在一个优选的实施方案中,将式(I)的化合物施用于哺乳动物。

[0404] 在另一个优选的实施方案中,将式(I)的化合物施用于禽类,即笼鸟,且特别是家禽。

[0405] 使用式(I)的化合物来防治动物寄生虫旨在减少或预防疾病、死亡病例及性能下降(在肉、奶、毛、皮、蛋、蜜等的情况下),从而使得动物饲养更经济和更简单,并可实现更好的动物健康。

[0406] 关于动物健康的领域,术语“防治(control)”或“防治(controlling)”意指式(I)的化合物有效地将特定寄生虫在受此类寄生虫感染的动物中的发病率降低至无害的程度。更具体地,本文中的“防治”意指式(I)的化合物可杀死各寄生虫、抑制其生长或抑制其增殖。

[0407] 节肢动物包括:

[0408] 虱目(Anoplurida),例如血虱属种(*Haematopinus* spp.)、毛虱属种(*Linognathus* spp.)、虱属种(*Pediculus* spp.)、阴虱属种(*Phtirus* spp.)、管虱属种(*Solenopotes* spp.);食毛目(Mallophagida)以及钝角亚目(Amblycerina)和丝角亚目(Ischnocerina),例如毛羽虱属种(*Trimenopon* spp.)、禽虱属种(*Menopon* spp.)、鸭虱属种(*Trinoton* spp.)、牛羽虱属种(*Bovicola* spp.)、*Werneckiella*属种、*Lepikentron*属种、畜虱属种(*Damalina* spp.)、嚼虱属种(*Trichodectes* spp.)、猫羽虱属种(*Felicola* spp.);双翅目(Diptera)以及长角亚目(Nematocerina)和短角亚目(Brachycerina),例如伊蚊属种(*Aedes* spp.)、按蚊属种(*Anopheles* spp.)、库蚊属种(*Culex* spp.)、蚋属种(*Simulium* spp.)、真蚋属种(*Eusimulium* spp.)、白蛉属种(*Phlebotomus* spp.)、罗蛉属种(*Lutzomyia*

spp.)、库蠓属种(*Culicoides* spp.)、斑虻属种(*Chrysops* spp.)、短蚋属种(*Odagmia* spp.)、维蚋属种(*Wilhelmia* spp.)、瘤虻属种(*Hybomitra* spp.)、黄虻属种(*Atylotus* spp.)、虻属种(*Tabanus* spp.)、麻虻属种(*Haematopota* spp.)、*Philipomyia*属种、蜂虻属种(*Braula* spp.)、家蝇属种(*Musca* spp.)、齿股蝇属种(*Hydrotaea* spp.)、螫蝇属种(*Stomoxys* spp.)、黑角蝇属种(*Haematobia* spp.)、莫蝇属种(*Morellia* spp.)、厕蝇属种(*Fannia* spp.)、舌蝇属种(*Glossina* spp.)、丽蝇属种(*Calliphora* spp.)、绿蝇属种(*Lucilia* spp.)、金蝇属种(*Chrysomyia* spp.)、污蝇属种(*Wohlfahrtia* spp.)、麻蝇属种(*Sarcophaga* spp.)、狂蝇属种(*Oestrus* spp.)、皮蝇属种(*Hypoderma* spp.)、胃蝇属种(*Gasterophilus* spp.)、虱蝇属种(*Hippobosca* spp.)、羊虱蝇属种(*Lipoptena* spp.)、蜚蝇属种(*Melophagus* spp.)、鼻狂蝇属种(*Rhinoestrus* spp.)、大蚊属种(*Tipula* spp.)；蚤目(*Siphonapterida*)，例如蚤属种(*Pulex* spp.)、栉首蚤属种(*Ctenocephalides* spp.)、潜蚤属种(*Tunga* spp.)、客蚤属种(*Xenopsylla* spp.)、角叶蚤属种(*Ceratophyllus* spp.)；[0409] 异翅目(*Heteropterida*)，例如臭虫属种(*Cimex* spp.)、锥猎蝽属种(*Triatoma* spp.)、红猎蝽属种(*Rhodnius* spp.)、锥蝽属种(*Panstrongylus* spp.)；以及来自蜚蠊目(*Blattarida*)的公害和卫生害虫。

[0410] 节肢动物还包括：

[0411] 蜱螨亚纲(*Acarari*) (螨蜱目(*Acarina*)) 和后气门目(*Metastigmata*)，例如软蜱科(*argasidae*)，如锐缘蜱属种(*Argas* spp.)、钝缘蜱属种(*Ornithodoros* spp.)、残喙蜱属种(*Otobius* spp.)；硬蜱科(*Ixodidae*)，如硬蜱属种(*Ixodes* spp.)、花蜱属种(*Amblyomma* spp.)、扇头蜱属种(牛蜱属种)(*Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp.)、革蜱属种(*Dermacentor* spp.)、血蜱属种(*Haemophysalis* spp.)、璃眼蜱属种(*Hyalomma* spp.)、扇头蜱属种(*Rhipicephalus* spp.) (多宿主蜱的原属)；中气门目(*Mesostigmata*)，如皮刺螨属种(*Dermanyssus* spp.)、禽刺螨属种(*Ornithonyssus* spp.)、肺刺螨属种(*Pneumonyssus* spp.)、刺利螨属种(*Raillietia* spp.)、肺刺螨属种(*Pneumonyssus* spp.)、胸刺螨属种(*Sternostoma* spp.)、蜂螨属种(*Varroa* spp.)、蜂盾螨属种(*Acarapis* spp.)；辐螨目(*Actinedida*) (前气门目(*Prostigmata*))，例如蜂盾螨属种(*Acarapis* spp.)、姬螯螨属种(*Cheyletiella* spp.)、禽螯螨属种(*Ornithocheyletiella* spp.)、肉螨属种(*Myobia* spp.)、疮螨属种(*Psorergates* spp.)、蠕形螨属种(*Demodex* spp.)、恙螨属种(*Trombicula* spp.)、*Neotrombiculla*属种、*Listrophorus*属种；以及粉螨目(*Acaridida*) (无气门亚目(*Astigmata*))，例如粉螨属种(*Acarus* spp.)、食酪螨属种(*Tyrophagus* spp.)、嗜木螨属种(*Caloglyphus* spp.)、颈下螨属种(*Hypodectes* spp.)、翅螨属种(*Pterolichus* spp.)、痒螨属种(*Psoroptes* spp.)、皮螨属种(*Chorioptes* spp.)、耳螨属种(*Otodectes* spp.)、疥螨属种(*Sarcoptes* spp.)、背肛螨属种(*Notoedres* spp.)、鸟疥螨属种(*Knemidocoptes* spp.)、胞螨属种(*Cytodites* spp.)、鸡雏螨属种(*Laminosioptes* spp.)。

[0412] 寄生的原生动物包括：

[0413] 鞭毛纲(*Mastigophora* (*Flagellata*))，例如，锥虫科(*Trypanosomatidae*)，如布氏锥虫(*Trypanosoma b. brucei*)、冈比亚锥虫(*T. b. gambiense*)、罗德森锥虫(*T. b. rhodesiense*)、刚果锥虫(*T. congolense*)、克鲁兹锥虫(*T. cruzi*)、伊氏锥虫(*T. evansi*)、马锥虫(*T. equinum*)、刘氏锥虫(*T. lewisi*)、鲈鱼锥虫(*T. percae*)、猿猴锥虫

(*T.simiae*)、活跃锥虫(*T.vivax*)、巴西利什曼虫(*Leishmania brasiliensis*)、多氏利什曼虫(*L.donovani*)、热带利什曼虫(*L.tropica*)，例如毛滴虫科(*Trichomonadidae*)，例如兰氏贾第虫(*Giardia lamblia*)、犬贾第虫(*G.canis*)；

[0414] 肉鞭毛虫亚门(根足总纲)(*Sarcomastigophora* (*Rhizopoda*))，例如内阿米巴科(*Entamoebidae*)，例如痢疾内阿米巴(*Entamoeba histolytica*)；哈氏虫科(*Hartmanellidae*)，例如棘变形虫属种(*Acanthamoeba* sp.)、哈氏虫属种(*Harmanella* sp.)；

[0415] 顶复亚门(孢子纲)(*Apicomplexa* (*Sporozoa*))，例如艾美虫科(*Eimeridae*)，例如堆形艾美虫(*Eimeria acervulina*)、腺样艾美虫(*E.adenoides*)、阿州艾美虫(*E.alabamensis*)、鸭艾美虫(*E.anatis*)、鹅艾美虫(*E.anserina*)、阿氏艾美虫(*E.arloingi*)、阿洛尼氏艾美虫(*E.ashata*)、奥本艾美虫(*E.auburnensis*)、牛艾美虫(*E.bovis*)、波氏艾美虫(*E.brunetti*)、犬艾美虫(*E.canis*)、美栗鼠艾美虫(*E.chinchillae*)、*E.clupearum*、鸽艾美虫(*E.columbae*)、*E.contorta*、槌状艾美虫(*E.crandalis*)、德氏艾美虫(*E.debliecki*)、散布艾美虫(*E.dispersa*)、椭圆艾美虫(*E.ellipsoidales*)、镰刀形艾美虫(*E.falciformis*)、福氏艾美虫(*E.faurei*)、黄色艾美虫(*E.flavescens*)、加洛帕沃尼艾美虫(*E.gallopavonis*)、哈氏艾美虫(*E.hagani*)、肠艾美虫(*E.intestinalis*)、*E.iroquoina*、无残艾美虫(*E.irresidua*)、唇艾美虫(*E.labbeana*)、勒氏艾美虫(*E.leucarti*)、大型艾美虫(*E.magna*)、巨型艾美虫(*E.maxima*)、中型艾美虫(*E.media*)、珠鸡艾美虫(*E.meleagridis*)、火鸡和缓艾美虫(*E.meleagrimitis*)、和缓艾美虫(*E.mitis*)、毒害艾美虫(*E.necatrix*)、雅氏艾美虫(*E.ninakohlyakimovae*)、羊艾美虫(*E.ovis*)、小型艾美虫(*E.parva*)、孔雀艾美虫(*E.pavonis*)、穿孔艾美虫(*E.perforans*)、*E.phasani*、梨形艾美虫(*E.piriformis*)、早熟艾美虫(*E.praecox*)、*E.residua*、粗糙艾美虫(*E.scabra*)、艾美虫属种(*E.spec.*)、斯氏艾美虫(*E.stiedai*)、猪艾美虫(*E.suis*)、禽艾美虫(*E.tenella*)、树艾美虫(*E.truncata*)、特鲁特艾美虫(*E.truttae*)、邱氏艾美虫(*E.zuernii*)、球虫属种(*Globidium spec.*)、贝氏等孢子虫(*Isospora belli*)、犬等孢子虫(*I.canis*)、猫等孢子虫(*I.felis*)、俄亥俄等孢子虫(*I.ohioensis*)、*I.rivolta*、等孢子虫属种(*I.spec.*)、猪等孢子虫(*I.suis*)、*Cystisospora*属种、隐孢子虫属种(*Cryptosporidium spec.*)，特别是*C.parvum*；例如弓形虫科(*Toxoplasmodidae*)，例如鼠弓形虫(*Toxoplasma gondii*)、*Hammondia heydornii*、犬新孢子虫(*Neospora caninum*)、贝斯虫(*Besnoitia besnoitii*)；例如肉孢子虫科(*Sarcocystidae*)，例如牛犬肉孢子虫(*Sarcocystis bovicanis*)、牛人肉孢子虫(*S.bovihominis*)、羊犬肉孢子虫(*S.ovicanis*)、羊猫肉孢子虫(*S.ovifelis*)、*S.neurona*、肉孢子虫属(*S.spec.*)、猪人肉孢子虫(*S.suihominis*)，例如*Leucozoidae*，例如*Leucozytozoon simondi*，例如症原虫科(*Plasmodiidae*)，例如，伯氏鼠症原虫(*Plasmodium berghei*)、镰状症原虫(*P.falciparum*)、三日症原虫(*P.malariae*)、卵形症原虫(*P.ovale*)、间日症原虫(*P.vivax*)，症原虫属种(*P.spec.*)，例如焦虫纲(*Piroplasma*)，例如阿根廷巴贝虫(*Babesia argentina*)、牛巴贝虫(*B.bovis*)、犬巴贝虫(*B.canis*)、巴贝虫属种(*B.spec.*)、泰勒原虫(*Theileria parva*)，泰勒虫属种(*Theileria spec.*)，例如匿虫亚目(*Adeleina*)，例如，犬肝簇虫(*Hepatozoon canis*)、肝簇虫属种(*H.spec.*)。

[0416] 蠕虫纲(helminths)的病原性内寄生虫,包括扁形动物(例如单殖亚纲(monogenea)、绦虫(cestodes)和吸虫(trematodes))、线虫、棘头纲(acanthocephala)及舌形虫属(pentastoma)。这些包括:

[0417] 单殖亚纲:例如,三代虫属种(Gyrodactylus spp.)、指环虫属种(Dactylogyrus spp.)、多盘吸虫属种(Polystoma spp.);

[0418] 绦虫:假叶目(Pseudophyllidea),例如:裂头绦虫属种(Diphyllobothrium spp.)、迭宫绦虫属种(Spirometra spp.)、裂头绦虫属种(Schistocephalus spp.)、舌状绦虫属种(Ligula spp.)、吸叶绦虫属种(Bothridium spp.)、复殖孔绦虫属种(Diplogonoporus spp.);

[0419] 圆叶目(Cyclophyllidea),例如:中殖孔绦虫属种(Mesocestoides spp.)、裸头绦虫属种(Anoplocephala spp.)、Paranoplocephala属种、蒙尼绦虫属种(Moniezia spp.)、Thysanosomsa属种、曲子宫绦虫属种(Thysaniezia spp.)、无卵黄腺绦虫属种(Avitellina spp.)、斯泰勒绦虫属种(Stilesia spp.)、鸣绦虫属种(Cittotaenia spp.)、Andyra属种、伯特绦虫属种(Bertiella spp.)、血寄生绦虫属种(Taenia spp.)、棘球绦虫属种(Echinococcus spp.)、泡尾绦虫属种(Hydaticera spp.)、代凡绦虫属种(Davainea spp.)、瑞利绦虫属种(Raillietina spp.)、膜壳绦虫属种(Hymenolepis spp.)、棘鳞绦虫属种(Echinolepis spp.)、棘叶绦虫属种(Echinocotyle spp.)、双睾绦虫属种(Diorchis spp.)、犬复孔绦虫属种(Dipylidium spp.)、约优克斯绦虫属种(Joyeuxiella spp.)、复孔绦虫属种(Diplopylidium spp.);

[0420] 吸虫:复殖纲(Digenea),例如:双穴吸虫属种(Diplostomum spp.)、茎穴吸虫属种(Posthodiplostomum spp.)、血吸虫属种(Schistosoma spp.)、毛毕吸虫属种(Trichobilharzia spp.)、鸟毕吸虫属种(Ornithobilharzia spp.)、澳毕吸虫属种(Austrotrichobilharzia spp.)、巨毕吸虫属种(Gigantobilharzia spp.)、彩蚴吸虫属种(Leucochloridium spp.)、短咽类吸虫属种(Brachylaima spp.)、棘口吸虫属种(Echinostoma spp.)、棘缘吸虫属种(Echinoparyphium spp.)、棘隙吸虫属种(Echinochasmus spp.)、低颈吸虫属种(Hyporaeum spp.)、片形吸虫属种(Fasciola spp.)、片形吸虫属种(Fascioloides spp.)、姜片虫属种(Fasciolopsis spp.)、环腔吸虫属种(Cyclocoelum spp.)、盲腔吸虫属种(Typhlocoelum spp.)、同盘吸虫属种(Paramphistomum spp.)、杯殖吸虫属种(Calicophoron spp.)、殖盘吸虫属种(Cotylophoron spp.)、Gigantocotyle属种、菲策吸虫属种(Fischoederius spp.)、Gastrothylacus属种、背孔吸虫属种(Notocotylus spp.)、下弯吸虫属种(Catatropis spp.)、斜睾吸虫属种(Plagiorchis spp.)、前殖吸虫属种(Prosthogonimus spp.)、双腔吸虫属种(Dicrocoelium spp.)、阔盘吸虫属种(Eurytoma spp.)、鲑吸虫属种(Troglosetrema spp.)、并殖吸虫属种(Paragonimus spp.)、豆形肛瘤吸虫属种(Collyriclum spp.)、侏形吸虫属种(Nanophyetus spp.)、后睾吸虫属种(Opisthorchis spp.)、支睾吸虫属种(Clonorchis spp.)、次睾吸虫属种(Metorchis spp.)、异形吸虫属种(Heterophyes spp.)、后殖吸虫属种(Metagonimus spp.);

[0421] 线虫:Trichinellida,例如:鞭虫属种(Trichuris spp.)、毛细线虫属种(Capillaria spp.)、Paracapillaria属种、真鞘线虫属种(Eucoleus spp.)、

Trichomosoides属种、旋毛形线虫属种(Trichinella spp.);

[0422] 垫刃目(Tylenchida),例如:细丝鲶属种(Micronema spp.)、类圆线虫属种(Strongyloides spp.);

[0423] 小杆目(Rhabditina),例如:圆线虫属种(Strongylus spp.)、三齿属种(Triodontophorus spp.)、食道齿属种(Oesophagodontus spp.)、毛线属种(Trichonema spp.)、辐首属种(Gyalocephalus spp.)、柱咽属种(Cylindropharynx spp.)、孟口属种(Poteriostomum spp.)、Cyclococercus属种、Cylicostephanus属种、结节线虫属种(Oesophagostomum spp.)、夏氏线虫属种(Chabertia spp.)、冠线虫属种(Stephanurus spp.)、钩口线虫属种(Ancylostoma spp.)、钩虫属种(Uncinaria spp.)、板口线虫属种(Necator spp.)、仰口线虫属种(Bunostomum spp.)、球首属种(Globocephalus spp.)、比翼线虫属种(Syngamus spp.)、Cyathostoma属种、后圆线虫属种(Metastrongylus spp.)、网尾线虫属种(Dictyocaulus spp.)、缪勒线虫属种(Muellerius spp.)、原圆线虫属种(Protostrongylus spp.)、Neostongylus属种、囊尾线虫属种(Cystocaulus spp.)、Pneumostongylus属种、Spicocaulus属种、鹿圆线虫属种(Elaphostongylus spp.)、副鹿圆线虫属种(Parelaphostongylus spp.)、环体线虫属种(Crenosoma spp.)、Paracrenosoma属种、奥斯勒线虫属种(Oslerus spp.)、血管圆线虫属种(Angiostrongylus spp.)、猫圆线虫属种(Aelurostrongylus spp.)、类丝虫属种(Filaroides spp.)、副类线虫属种(Parafilaroides spp.)、毛圆线虫属种(Trichostrongylus spp.)、血矛线虫属种(Haemonchus spp.)、胃线虫属种(Ostertagia spp.)、背带线虫属种(Teladorsagia spp.)、马歇尔线虫属种(Marshallagia spp.)、短古柏线虫属种(Cooperia spp.)、日圆线虫属种(Nippostrongylus spp.)、螺旋线虫属种(Heligosomoides spp.)、细颈线虫属种(Nematodirus spp.)、猪圆线虫属种(Hyostrongylus spp.)、尖柱线虫属种(Obeliscoides spp.)、裂口线虫属种(Amidostomum spp.)、盘头线虫属种(Ollulanus spp.);

[0424] 旋尾目(Spirurida),例如:尖尾线虫属种(Oxyuris spp.)、蛲虫属种(Enterobius spp.)、栓尾线虫属种(Passalurus spp.)、三种管状属种(Syphacia spp.)、无刺线虫属种(Aspiculuris spp.)、异刺属种(Heterakis spp.);蛔虫属种(Ascaris spp.)、弓蛔线虫属种(Toxascaris spp.)、弓蛔虫属种(Toxocara spp.)、贝利蛔线虫属种(Baylisascaris spp.)、副蛔虫属种(Parascaris spp.)、异尖线虫属种(Anisakis spp.)、鸡蛔虫属种(Ascaridia spp.);颚口线虫属种(Gnathostoma spp.)、泡翼线虫属种(Physaloptera spp.)、吸吮线虫属种(Thelazia spp.)、筒线虫属种(Gongylonema spp.)、丽线虫属种(Habronema spp.)、副柔线虫属种(Parabronema spp.)、德拉西线虫属种(Draschia spp.)、龙线虫属种(Dracunculus spp.);冠丝虫属种(Stephanofilaria spp.)、副丝虫属种(Parafilaria spp.)、腹腔丝虫属种(Setaria spp.)、罗阿丝虫属种(Loa spp.)、恶丝虫属种(Dirofilaria spp.)、类平滑丝虫属种(Litomosoides spp.)、布鲁格丝虫属种(Brugia spp.)、吴策线虫属种(Wuchereria spp.)、盘尾属种(Onchocerca spp.)、旋尾线虫属种(Spirocerca spp.);

[0425] 棘头虫纲(Acanthocephala):少棘目(Oligacanthorhynchida),例如:巨吻棘虫属种(Macracanthorhynchus spp.)、前睾棘头虫属种(Prosthenorchis spp.);多态目(Polymorphida),例如:细颈棘头虫属种(Filicollis spp.);念珠菌目(Moniliformida),

例如：念珠棘虫属种 (Moniliformis spp.)；

[0426] 棘吻目 (Echinorhynchida)，例如，棘头虫属种 (Acanthocephalus spp.)、棘吻虫属种 (Echinorhynchus spp.)、似细吻棘头虫属种 (Leptorhynchoides spp.)；

[0427] 舌形虫属 (Pentastoma)：蛇舌状虫目 (Porocephalida)，例如舌形虫属种 (Linguatula spp.)。

[0428] 在兽医领域和动物饲养中，式 (I) 的化合物以合适制剂的形式通过本领域中通常已知的方法 (例如肠内、肠胃外、皮肤或鼻途径) 给药。给药可以是预防性的或治疗性的。

[0429] 因此，本发明的一个实施方案涉及式 (I) 的化合物用作药物的用途。

[0430] 另一个方面涉及式 (I) 的化合物用作抗内寄生虫剂、特别是杀蠕虫剂或抗原生动物剂的用途。式 (I) 的化合物适于例如在畜牧业、动物繁育、动物圈养中及在卫生领域中用作抗内寄生虫剂、特别是杀蠕虫剂或抗原生动物剂。

[0431] 另一个方面还涉及式 (I) 的化合物用作抗外寄生虫剂、特别是杀节肢动物剂 (例如，杀昆虫剂或杀螨剂) 的用途。另一个方面涉及式 (I) 的化合物例如在畜牧业、动物育种、动物圈养中或在卫生领域中用作抗外寄生虫剂，特别是杀节肢动物剂 (例如，杀昆虫剂或杀螨剂) 的用途。

[0432] 抗蠕虫混配组分

[0433] 例如可提及下列抗蠕虫混配组分：

[0434] 包括杀线虫和杀绦虫活性化合物的抗蠕虫活性化合物：

[0435] 大环内酯类，例如，阿维菌素 (abamectin)、多拉菌素 (doramectin)、甲氨基阿维菌素 (emamectin)、依立诺克丁 (eprinomectin)、伊佛霉素 (ivermectin)、米尔倍霉素 (milbemycin)、莫西菌素 (moxidectin)、尼莫克汀 (nemadectin)、塞拉菌素 (selamectin)；

[0436] 苯并咪唑类和聚苯并咪唑类 (probenzimidazoles)，例如，阿苯达唑 (albendazole)、阿苯达唑亚砷 (albendazole-sulphoxide)、坎苯达唑 (cambendazole)、环苯达唑 (cyclobendazole)、非班太 (febantel)、芬苯达唑 (fenbendazole)、氟苯达唑 (flubendazole)、甲苯达唑 (mebendazole)、奈托比胺 (netobimin)、奥芬达唑 (oxfendazole)、奥苯达唑 (oxibendazole)、丁苯咪酯 (parbendazole)、噻苯达唑 (thiabendazole)、托布津 (thiophanate)、三氯苯达唑 (triclabendazole)；

[0437] 环辛缩肽 (cyclooctadepsipeptides) 类，例如，emodepside、PF1022；

[0438] 氨基乙腈衍生物类，例如，monepantel；

[0439] 四氢嘧啶类，例如：甲噻嘧啶 (morantel)、噻嘧啶 (pyrantel)、奥克太尔 (oxantel)；

[0440] 咪唑并噻唑类 (Imidazothiazoles)，例如，丁咪唑 (butamisol)、左旋咪唑 (levamisole)、四咪唑 (tetramisol)；

[0441] 水杨酰苯胺 (salicylanilides) 类，例如，溴沙尼特 (bromoxanide)、溴替尼特 (brotianide)、氯碘沙尼 (clioxanide)、氯生太尔 (closantel)、氯硝柳胺 (niclosamide)、羟氯扎胺 (oxyclozanide)、雷复尼特 (rafoxanide)、三溴水杨酰苯胺 (tribromsalan)；

[0442] paraherquamides 类，例如得曲恩特 (derquantel)、paraherquamide；

[0443] 氨基苯基脒类，例如：阿米登太 (amidantel)、脱酰基的阿米登太 (dAMD)、三苯双脒；

[0444] 有机磷酸酯类,例如,蝇毒磷(coumaphos)、育畜磷(crufomate)、敌敌畏(dichlorvos)、哈洛克酮(haloxone)、驱虫磷(naphthalofos)、敌百虫(trichlorfon);

[0445] 取代的苯酚类,例如,硫氯酚(bithionol)、二碘硝酚(disophenol)、六氯酚(hexachlorophene)、硝氯酚(niclofolan)、联硝氯酚(meniclopholan)、硝碘酚腈(nitroxynil);

[0446] 哌嗪酮,例如:吡喹酮(praziquantel)、依西太尔(epsiprantel);

[0447] 各种其他种类,例如,硝硫氰胺(amoscanate)、酚乙铵(bephenium)、丁萘脒(bunamidine)、氯硝安定(clonazepam)、氯舒隆(clorsulon)、联胺苯醚(diamfenetid)、双氯酚(dichlorophen)、乙胺嗪(diethylcarbamazine)、吐根碱(emetine)、三氯苯丙酰嗪(hetolin)、海恩酮(hycanthone)、硫蒽酮(lucanthone)、盐酸卢甘宋(Miracil)、mirasan、氯硝柳胺(niclosamide)、硝唑咪(niridazole)、硝碘酚腈(nitroxynil)、硝硫氰酯(nitroscanate)、奥替普拉(oltipraz)、omphalotin、奥沙尼喹(oxamniquin)、巴龙霉素(paromomycin)、哌嗪(piperazine)、雷琐太尔(resorantel)。

[0448] 病媒防治

[0449] 式(I)的化合物还可用于病媒防治。在本发明的上下文中,病媒为能够将病原体(例如病毒、蠕虫、单细胞生物和细菌)从贮主(reservoir)(植物、动物、人等)传播至宿主的节肢动物,尤其是昆虫或蛛形纲动物。病原体可被机械地(例如通过无刺蝇(non-stinging)传播沙眼)传播至宿主,或者可在注射(例如通过蚊子传播疟原虫)后传播至宿主。

[0450] 病媒及其传播的疾病或病原体的实例为:

[0451] 1) 蚊

[0452] -按蚊属:疟疾、丝虫病;

[0453] -库蚊属:日本脑炎、丝虫病、其他病毒性疾病、蠕虫的传播;

[0454] -伊蚊属:黄热病、登革热、丝虫病、其他病毒性疾病;

[0455] -蚋科:蠕虫,特别是旋盘尾丝虫(*Onchocerca volvulus*)的传播;

[0456] 2) 虱:皮肤感染、流行性斑疹伤寒;

[0457] 3) 蚤:鼠疫、地方性斑疹伤寒;

[0458] 4) 蝇类:昏睡病(锥体虫病(*trypanosomiasis*))、霍乱、其他细菌性疾病;

[0459] 5) 螨:螨病壁虱病、流行性斑疹伤寒、立克次氏体痘、土拉菌病、圣路易斯脑炎(Saint Louis encephalitis)、蜱媒脑炎(tick-borne encephalitis)(TBE)、克里米亚-刚果出血热(Crimean-Congo haemorrhagic fever)、疏螺旋体病(borreliosis);

[0460] 6) 蜱:疏螺旋体病(borreliosis)如达氏疏螺旋体(*Borrelia duttoni*)、蜱媒脑炎、Q热(贝氏柯克斯体(*Coxiella burnetii*))、焦虫病(babesiosis)(犬巴贝斯虫(*Babesia canis canis*))。

[0461] 在本发明的上下文中,病媒的实例为可将植物病毒传播至植物的昆虫,例如蚜虫、蝇、叶蝉或蓟马(thrip)。其他能够传播植物病毒的其他病媒为蛛螨、虱、甲虫和线虫。

[0462] 在本发明的上下文中,病媒的其他实例为可将病原体传播至动物和/或人的昆虫和蛛形纲动物,例如蚊,尤其是伊蚊属,按蚊属例如冈比亚按蚊(*A.gambiae*)、阿拉伯按蚊(*A.arabiensis*)、不吉按蚊(*A.funestus*)、大劣按蚊(*A.dirus*)(疟疾),及库蚊属;虱;跳蚤;蝇;螨;及蜱。

[0463] 如果式(I)的化合物为抗破坏性的,则病媒防治也是可能的。

[0464] 式(I)的化合物适用于预防通过病媒传播的疾病和/或病原体。因此,本发明的另一个方面为式(I)的化合物在例如农业、园艺、林业、园林以及休闲设施中,以及在材料和贮存产品的保护中用于病媒防治的用途。

[0465] 工业材料的保护

[0466] 式(I)的化合物适合用于保护工业材料免受昆虫的侵袭或破坏,所述昆虫例如来自鞘翅目、膜翅目、等翅目、鳞翅目、啮虫目和衣鱼目(Zygentoma)。

[0467] 在本文中,工业材料应理解为意指无生命材料,例如优选塑料、胶粘剂、胶料、纸类和卡片、皮革、木材、加工木制品和涂料组合物。特别优选本发明用于保护木材的用途。

[0468] 在另一个实施方案中,式(I)的化合物与至少一种其他杀昆虫剂和/或至少一种杀真菌剂一起使用。

[0469] 在另一个实施方案中,式(I)的化合物以即用型(ready-to-use)农药的形式存在,即可不经进一步的修饰而可应用于所讨论的材料。合适的其他杀昆虫剂或杀真菌剂特别为上述提及的那些。

[0470] 令人惊讶地,还已经发现,式(I)的化合物可用于保护与盐水或微咸水接触的物体(特别是船体、筛、网、建筑物、系船设备及信号系统)免受污损。式(I)的化合物同样可单独或与其他活性化合物结合地用作防污剂。

[0471] 卫生领域中动物害虫的防治

[0472] 式(I)的化合物适合用于防治卫生领域中的动物害虫。更具体而言,本发明可以用于家用保护领域、卫生保护领域和储存产品的保护中,特别是用于在封闭空间(例如住所、工厂车间、办公室、车辆舱室)中遇到的昆虫、蛛形纲动物和螨。为了防治动物害虫,将式(I)的化合物单独使用或与其他活性化合物和/或助剂结合使用。它们优选用于家用的杀昆虫剂产品中。式(I)的化合物对敏感和抗性物种以及对全部发育阶段均有效。

[0473] 这些害虫包括,例如,来自下述的害虫:蛛形纲,蝎目(Scorpiones)、蜘蛛目(Araneae)和盲蛛目(Opiliones);唇足纲和倍足纲;昆虫纲,蜚蠊目、鞘翅目、革翅目、双翅目、异翅目、膜翅目、等翅目、鳞翅目、虱目(Phthiraptera)、啮虫目、跳跃目(Saltatoria)或直翅目、蚤目和衣鱼目;以及软甲亚纲(Malacostraca),等足目。

[0474] 在用于撒播扩展的诱饵或诱饵站(baitstation)中,施用以下列形式进行施用:例如,气雾剂、;无压喷雾产品,如泵式喷雾剂和雾化喷雾剂、;自动起雾体系、;喷雾烟雾剂、;泡沫剂、;凝胶剂、;具有由纤维素或塑料制成的蒸发片剂(evaporatortablet)的蒸发产品、;液体蒸发剂、;凝胶和薄膜蒸发剂、;推进器驱动的蒸发剂、;无动力(energy-free)或无源(passive)的蒸发体系、;捕蛾纸、捕蛾袋和捕蛾胶;作为颗粒剂或粉剂。

[0475] 方法和中间体的说明

[0476] 以下制备实施例和用途实施例说明本发明而不限本本发明。产物通过¹H-NMR光谱和/或LC-MS(液相色谱质谱联用)进行表征。

[0477] logP值根据OECD Guideline 117(EC Directive 92/69/EEC)通过HPLC(高效液相色谱法)使用反相(RP)柱(C18)由以下方法测定:

[0478] [a]酸性范围内的LC-MS测定用0.1%甲酸水溶液和乙腈(含0.1%甲酸)作为流动相在pH 2.7下进行;线性梯度为10%乙腈至95%乙腈。

[0479] [b]中性范围内的LC-MS测定用0.001摩尔的碳酸氢铵水溶液和乙腈作为流动相在pH 7.8下进行;线性梯度为10%乙腈至95%乙腈。

[0480] 使用具有已知logP值(logP值基于保留时间通过两个连续烷酮之间的线性内插值来测定)的非支化烷-2-酮(具有3至16个碳原子)进行校准。

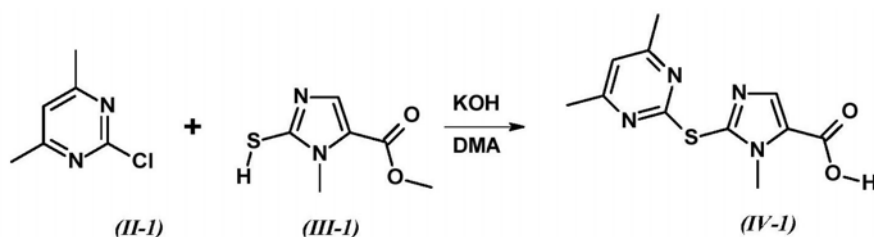
[0481] NMR谱使用配有流量探头(60 μ l体积)的Bruker Avance 400测定。在个别情况下, NMR谱用Bruker Avance II 600测量。

[0482] 所选实施例的NMR数据以经典形式(δ 值,多重分裂,氢原子数)表示。信号的分裂描述如下:s(单峰)、d(双峰)、t(三重峰)、q(四重峰)、quint(五重峰)、m(多重峰)、br(宽信号)。所用的溶剂是CD₃CN、CDCl₃或D₆-DMSO,并使用四甲基硅烷(0.00ppm)作为参考。

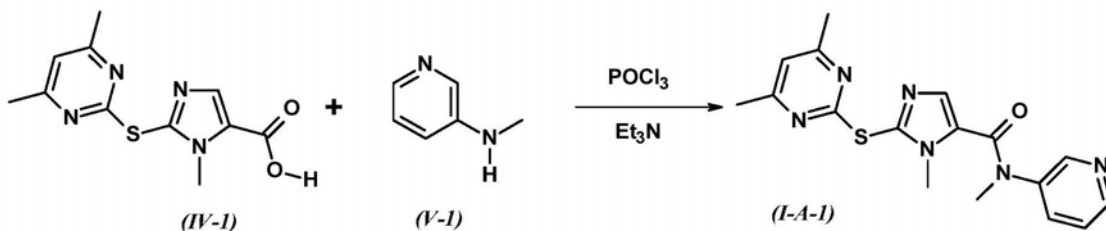
[0483] 制备实施例

[0484] 方法A和B

[0485] 实施例(I-A-1)



[0486]



[0487] 制备化合物(IV-1)

[0488] 将1.46g (10mmol) 2-氯-4,6-二甲基嘧啶、0.62g (11mmol) 粉状氢氧化钾和1.72g (10mmol) 1-甲基-2-巯基咪唑-5-羧酸甲酯在30ml二甲基乙酰胺(DMA)中合并,并在120℃的温度下搅拌过夜。在旋转蒸发器上在减压下除去溶剂,并且将残余物溶于水中,用二氯甲烷萃取。将水相用2N盐酸酸化,并且将沉淀物抽滤出并干燥。产量:443mg(理论值的15.8%)

[0489] logP[a]:0.81

[0490] ¹H-NMR (d₆-DMSO, 400MHz); δ =2.30 (s, 6H), 3.34 (s, 3H), 7.07 (s, 1H), 7.75 (s, 1H), 13.19 (s, br, 1H) ppm.

[0491] 制备实施例(I-A-1)

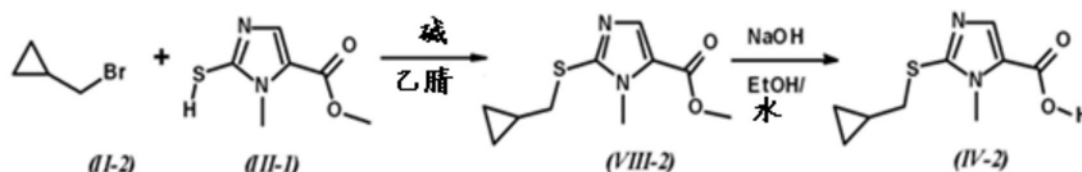
[0492] 在室温下,首先将0.339g (1.18mmol) 化合物(IV-1)加入15ml无水四氢呋喃(THF)中,并加入0.17ml (1.18mmol) 三乙胺。将混合物搅拌5min,然后加入0.14g (1.3mmol) 3-甲基氨基吡啶,并将混合物再搅拌15min。随后加入0.46ml (3.31mmol) 三乙胺,之后立即逐滴加入0.11g (0.71mmol) 三氯化磷,然后将混合物回流沸腾30min。将混合物减压浓缩,并将残余物通过RP中压柱色谱法使用水/乙腈流动相梯度进行纯化。产量:77mg(理论值的17.7%)

[0493] logP[a]:1.31; logP[n]:1.41

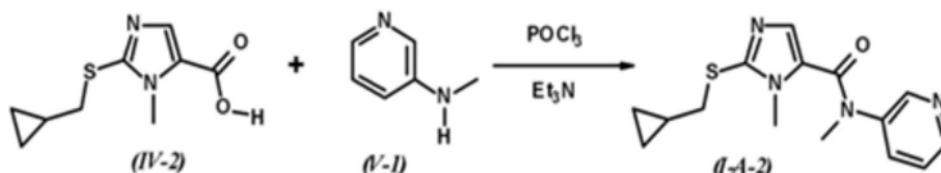
[0494] ¹H-NMR (CD₃CN, 400MHz); δ =2.32 (s, 6H), 3.43 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 6.43 (s, 1H),

6.90 (s, 1H), 7.36–7.39 (m, 1H), 7.70–7.73 (m, 1H), 8.41–8.42 (d, 1H), 8.45–8.47 (m, 1H) ppm。

[0495] 实施例 (I-A-2)



[0496]



[0497] 制备化合物 (VIII-2)

[0498] 将0.81g (6mmol) 环丙基甲基溴化物、0.83g (6mmol) 粉状碳酸钾和0.861g (5mmol) 1-甲基-2-巯基咪唑-5-羧酸甲酯在20ml乙腈中合并,并将混合物在搅拌下回流加热5h。溶于酸性MeOH中得到白色粉末沉淀物,将该沉淀物抽滤出,然后通过MPLC在硅胶上使用流动相环己烷/乙酸乙酯 (1:1) 进行纯化。产量:210mg (理论值的18.6%)

[0499] $\log P[a]: 2.06; \log P[n]: 2.26$

[0500] $^1\text{H-NMR}$ (CD_3CN , 400MHz); $\delta = 0.26-0.30$ (m, 2H), $0.56-0.61$ (m, 2H), 1.10 (cm, 1H), $3.37-3.47$ (m, 2H), 3.88 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 7.97 (s, 1H) ppm。

[0501] 制备化合物 (IV-2)

[0502] 将0.210g (0.928mmol) 化合物 (VIII-2) 和0.186g (0.928mmol) 20%浓度的氢氧化钠水溶液于5ml乙醇中在40℃下搅拌1h。在减压下蒸发溶剂,并将残余物溶解在1ml水中并用1N HCl调节至pH 2。将溶液在减压下浓缩,并将残余物通过RP-MPLC使用水/乙腈梯度进行纯化。产量:155mg (理论值的78.7%)

[0503] $\log P[a]: 0.62; \log P[n]: -0.18$

[0504] $^1\text{H-NMR}$ (CD_3CN , 400MHz); $\delta = 0.23-0.26$ (m, 2H), $0.52-0.56$ (m, 2H), 1.12 (cm, 1H), $3.08-3.10$ (d, 2H), 3.77 (s, 3H), 7.66 (s, 1H) pp。

[0505] 制备实施例 (I-A-2)

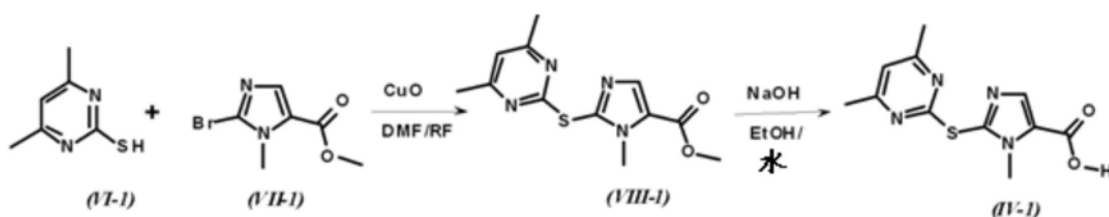
[0506] 在室温下,首先将0.14g (0.66mmol) 化合物 (IV-2) 加入10ml无水四氢呋喃 (THF) 中,并加入0.1ml (0.66mmol) 三乙胺。将混合物搅拌5min,然后加入0.078g (0.73mmol) 3-甲基氨基吡啶,并将混合物再搅拌15min。随后加入0.26ml (1.85mmol) 三乙胺,之后立即逐滴加入0.061g (0.4mmol) 三氯化磷,然后将混合物回流沸腾30min。将混合物减压浓缩,并将残余物通过MPLC在硅胶上使用流动相环己烷/乙酸乙酯 (1:1) 进行纯化。产量:35mg (理论值的14%)。

[0507] $\log P[a]: 1.28; \log P[n]: 1.81$

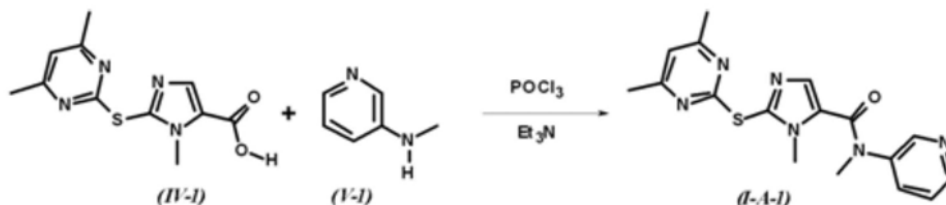
[0508] $^1\text{H-NMR}$ (CD_3CN , 400MHz); $\delta = 0.12-0.16$ (m, 2H), $0.47-0.51$ (m, 2H), 1.03 (cm, 1H), $2.94-2.96$ (d, 2H), 3.38 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 6.25 (s, 1H), $7.34-7.38$ (m, 1H), $7.66-7.69$ (m,

1H), 8.410–8.415 (d, 1H), 8.45–8.46 (m, 1H) ppm。

[0509] 制备方法B的中间体



[0510]



[0511] 制备化合物(VIII-1)

[0512] 在氩气下,将0.7g (5mmol) 2-巯基-4,6-二甲基嘧啶、0.75g (5.25mmol) 氧化亚铜(I) 和1.1g (5mmol) 1-甲基-2-溴咪唑-5-羧酸甲酯在60ml干燥的二甲基甲酰胺(DMF)中合并,并将混合物回流加热过夜。冷却至室温后,将反应混合物通过Celite抽滤出,用乙酸乙酯和热甲醇洗涤,将滤液用EDTA溶液萃取,分离出有机相,减压蒸发溶剂,并将残余物通过MPLC在硅胶上使用流动相环己烷/乙酸乙酯(1:1)进行纯化。产量:247mg(理论值的17.3%)

[0513] $\log P[a]: 1.78; \log P[n]: 1.80$

[0514] $^1\text{H-NMR}$ (CD_3CN , 400MHz); $\delta = 2.23$ (s, 6H), 3.85 (s, 3H), 3.87 (s, 3H), 6.92 (s, 1H), 7.77 (s, 1H) ppm。

[0515] 制备化合物(IV-1)

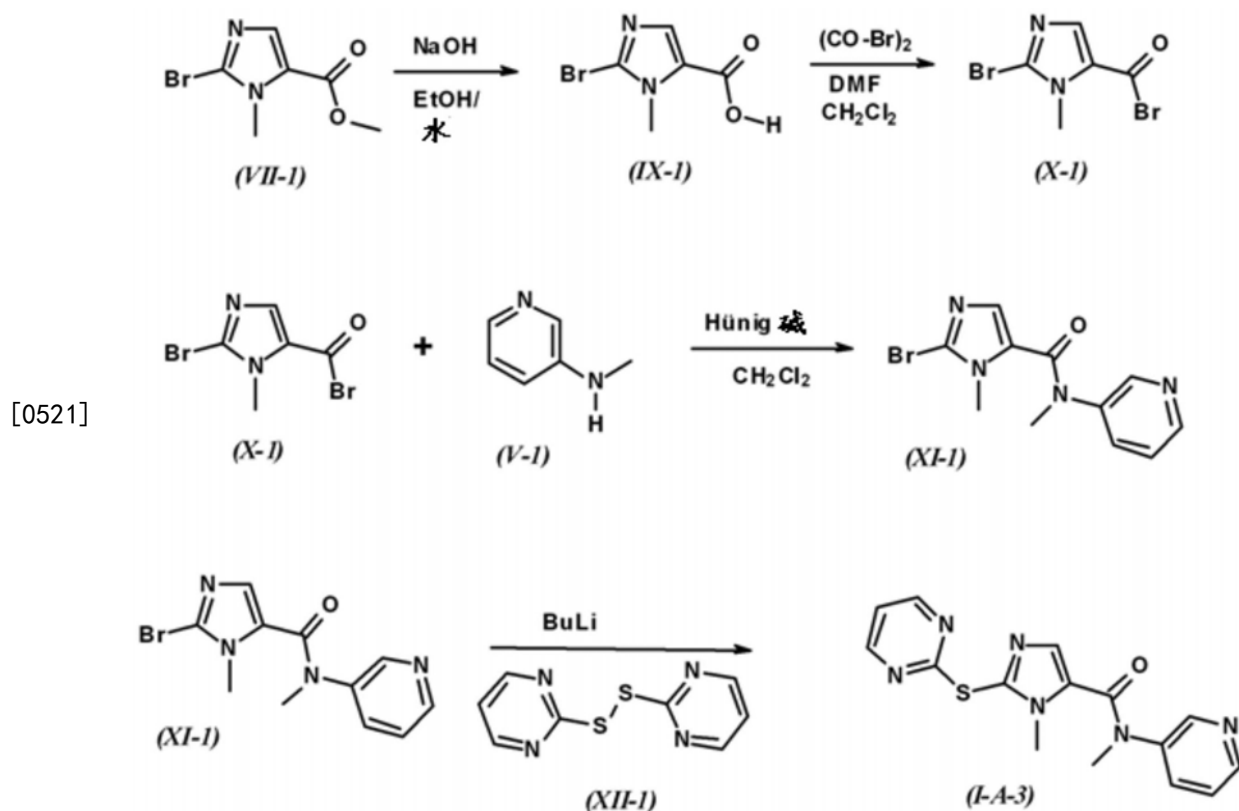
[0516] 将0.396g (1.42mmol) 化合物(VIII-1)和0.28g (1.42mmol) 20%浓度的氢氧化钠水溶液于10ml乙醇中在40℃下搅拌1h。在减压下蒸发溶剂,并将残余物溶解在2ml水中,并用1N HCl调节至pH 2。将沉淀物抽滤出并干燥。产量:339mg(理论值的83%)

[0517] $\log P[a]: 0.81$

[0518] $^1\text{H-NMR}$ (CD_3CN , 400MHz); $\delta = 2.23$ (s, 6H), 3.86 (s, 3H), 6.92 (s, 1H), 7.77 (s, 1H) ppm。

[0519] 方法C-1

[0520] 实施例(I-A-3)



[0522] 制备化合物 (IX-1)

[0523] 将1g (4.565mmol) 1-甲基-2-溴咪唑-5-羧酸甲酯 (VII-1) 溶解在10ml乙醇中,加入5.48ml 1N NaOH(水溶液),并将混合物在室温下搅拌60min。加入5.5ml 1N HCl(水溶液)(调节至pH~3)之后,形成白色沉淀物。将混合物浓缩至干燥物,并且在超声浴中悬浮在6ml水中。将白色晶体滤出并用2ml的水洗涤。将母液几乎浓缩至干燥物。将晶体抽滤出并用少量水洗涤。将合并的晶体在油泵真空下干燥。产量:890mg(理论值的95%)。

[0524] $\log P[a]: 0.31$;

[0525] $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO, 400MHz); $\delta = 3.82$ (s, 3H), 7.60 (s, 1H), 13.15 (s, 1H) ppm。

[0526] 制备化合物 (X-1)

[0527] 使用注射器套管,将约60mg DMF加入890mg (4.341mmol) 1-甲基-2-溴咪唑-5-羧酸 (IX-1) 于15ml二氯甲烷的悬浮液中。在室温下,加入940mg (4.341mmol) 草酰溴,导致剧烈释放出气体。第二天,再加入10ml二氯甲烷和140mg草酰溴。在室温下搅拌1h之后,再加入110mg草酰溴和30mg DMF,并将混合物在室温下再搅拌一小时,LC/MS显示转化率为96%。无需进一步后处理,将悬浮液用于合成化合物 (XI-1)。

[0528] 制备化合物 (XI-1)

[0529] 将14.02g (40.19mmol) 1-甲基-2-溴咪唑-5-碳酰溴 (X-1) 悬浮在80ml二氯甲烷中,并将悬浮液冷却至0℃。在0℃下,加入4.35g (40.19mmol) 3-甲基氨基吡啶 (V-1) 和41ml (241.2mmol) Hünig碱溶于40ml二氯甲烷的溶液。将混合物在室温下搅拌1h,然后回流沸腾4h,并使其在室温下静止过夜。减压浓缩混合物。将残余物溶于500ml二氯甲烷中,并用总共400ml水洗涤3次(2次约200ml,1次约100ml)。将合并的水相用约50ml二氯甲烷萃取,并合并有机相。将合并的有机相用NaHCO₃水溶液(3.5g NaHCO₃于150ml水中)洗涤2次。将合并的水相用约50ml二氯甲烷萃取,并且将有机相合并,在减压下干燥并浓缩。产量:10.45g(理论值

的81.9%) 棕色粘稠油状物,LC/MS纯度为93%。

[0530] $\log P[a]:0.65; \log P[n]:0.93$

[0531] $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO, 400MHz); $\delta=3.37$ (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 6.25 (s, 1H), 7.43-7.47 (m, 1H), 7.84-7.87 (m, 1H), 8.48-8.49 (m, 1H), 8.52 (m, 1H) ppm。

[0532] 化合物 (I-A-3)

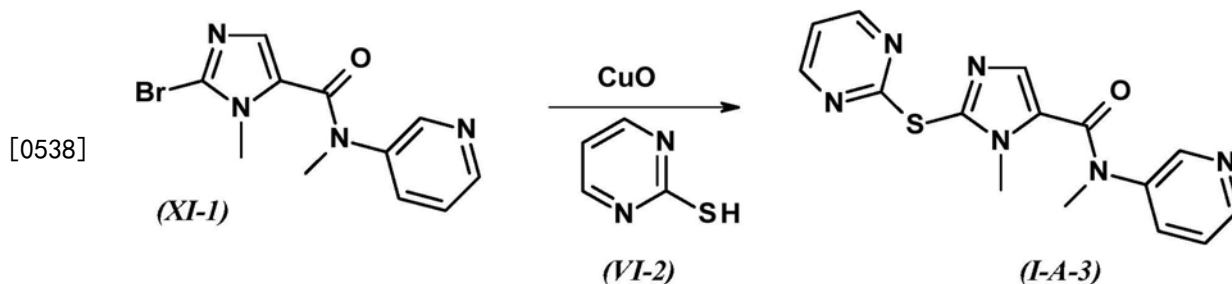
[0533] 将0.54g (1.83mmol) 化合物 (XI-1) 溶解在5ml THF中,并将溶液冷却至 $<-70^\circ\text{C}$ 。在此温度下,在10分钟内逐滴加入0.75ml (1.83mmol) 2.5摩尔n-BuLi于己烷的溶液,并将混合物再搅拌15分钟。然后,逐滴加入溶于5ml THF中的0.407g化合物 (XII-1)。将混合物在 $<-70^\circ\text{C}$ 下再搅拌45分钟。在 -70°C 下,用氯化铵溶液淬灭该混合物,用二氯甲烷萃取产物,并且将溶液在减压下干燥并浓缩。将残余物通过MPLC在硅胶上使用二氯甲烷/乙醇梯度作为流动相进行分离。产量:113mg (理论值的17%)

[0534] $\log P[a]:0.69; \log P[n]:0.98$

[0535] $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO, 400MHz); $\delta=3.41$ (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 6.49 (s, 1H), 6.90 (s, 1H), 7.32-7.34 (t, 1H), 7.45-7.48 (m, 1H), 7.84-7.86 (m, 1H), 8.48-8.50 (m, 1H), 8.51-8.53 (m, 1H), 8.63-8.64 (d, 2H) ppm。

[0536] 方法C-2

[0537] 化合物 (I-A-3)



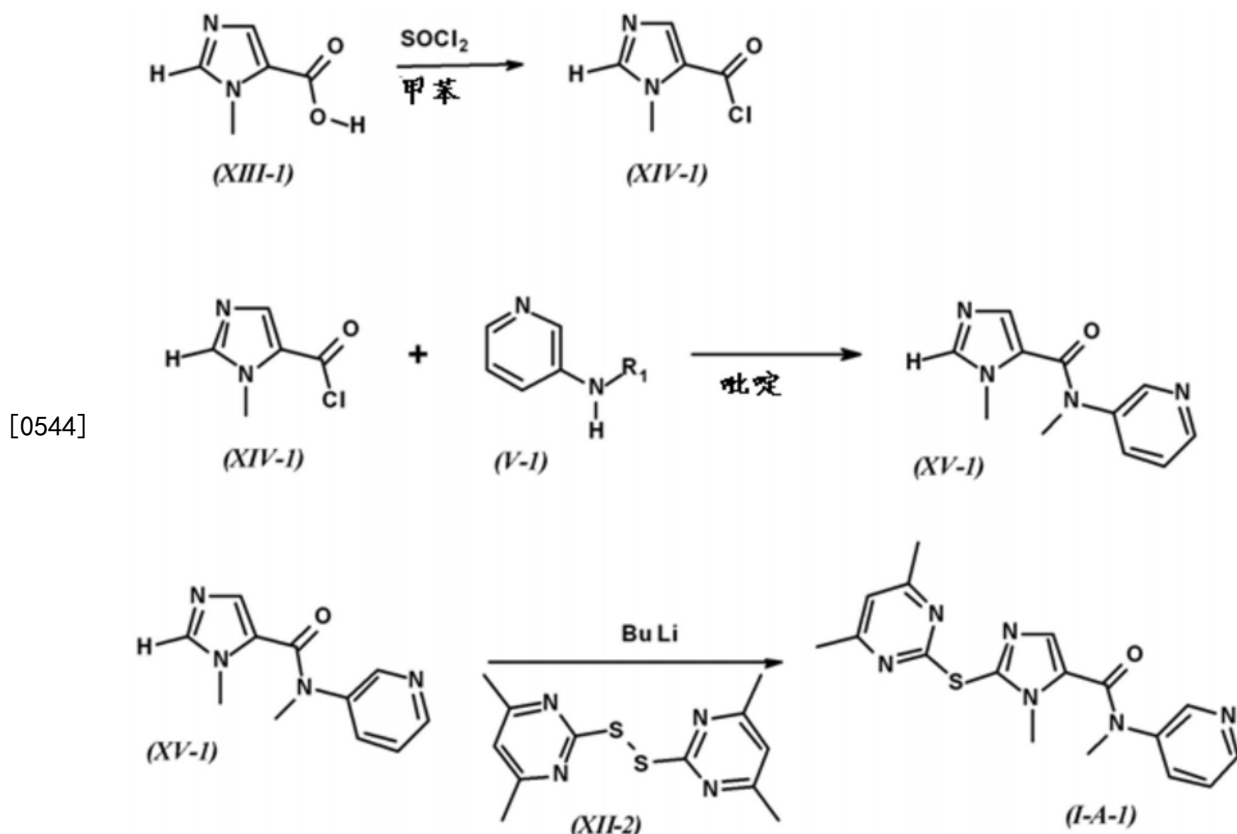
[0539] 将0.456g (4.066mmol) 2-巯基嘧啶、0.64g (4.473mmol) 氧化亚铜(I) 和1.2g (4.066mmol) 化合物 (XI-1) 在12ml干燥的二甲基甲酰胺(DMF)中合并,并回流加热3h。在冷却至室温后,通过Celite过滤反应混合物,减压蒸发溶剂,并将残余物通过MPLC在硅胶上使用二氯甲烷/甲醇梯度作为流动相进行纯化。产量:408mg (理论值的30%)。

[0540] $\log P[n]:0.98$

[0541] $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO, 400MHz); $\delta=3.41$ (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 6.49 (s, 1H), 6.90 (s, 1H), 7.32-7.34 (t, 1H), 7.45-7.48 (m, 1H), 7.84-7.86 (m, 1H), 8.48-8.50 (m, 1H), 8.51-8.53 (m, 1H), 8.63-8.64 (d, 2H) ppm。

[0542] 方法D

[0543] 化合物 (I-A-1)



[0545] 制备化合物 (XV-1)

[0546] 将12.71g (104.7mmol) 亚硫酸氯加入12g (95.2mmol) 1-甲基咪唑-5-羧酸 (XIII-1) 于72ml 甲苯的悬浮液中, 并将混合物在130℃下搅拌过夜。减压浓缩反应混合物。向残余物中加入10.3g (95.2mmol) 3-甲基氨基吡啶 (V-1) 于72ml 吡啶的溶液, 并将得到的反应混合物在115℃下加热4h。然后再次减压浓缩混合物, 并将残余物通过柱色谱法在硅胶上使用流动相乙腈/甲醇 (3:1) 进行纯化。这得到8.1g (理论值的39.3%) 标题化合物 (XV-1) 和9.5g (理论值的37.1%) 标题化合物的盐酸盐。

[0547] $\log P[n]: 0.42$

[0548] $^1\text{H-NMR}$ (CD_3CN , 400MHz); $\delta = 3.39$ (s, 3H), 3.81 (s, 3H), 6.17 (s, 1H), 7.36–7.40 (m, 2H), 7.67–7.70 (m, 1H), 8.41 (m, 1H), 8.47 (m, 1H) ppm。

[0549] 实施例 (I-A-1)

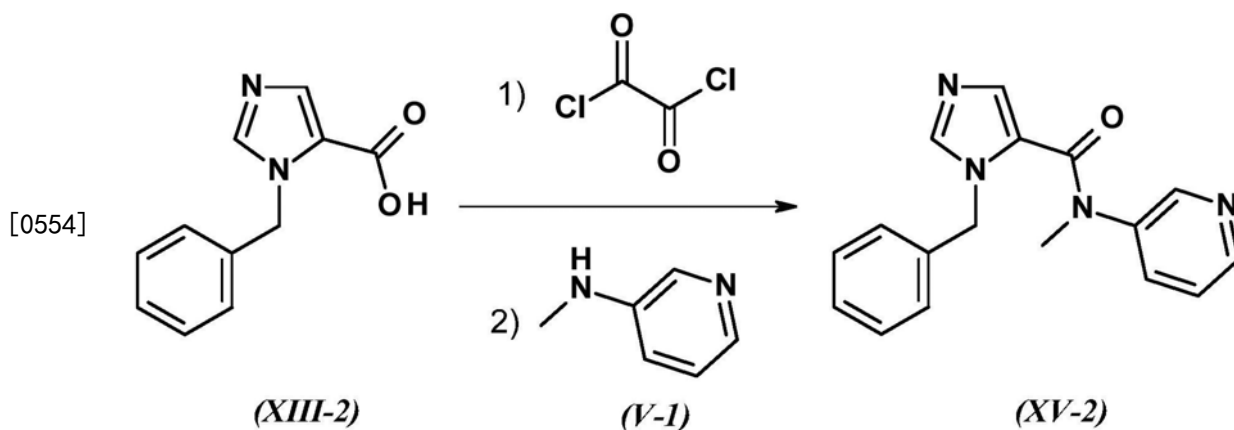
[0550] 将0.500g (2.31mmol) 化合物 (XV-1) 溶解在10ml THF中, 并将混合物冷却至-85℃。在反应期间, 将温度保持在-82至-90℃。在该温度下, 在5分钟内逐滴加入0.91ml (2.4mmol) 2.5摩尔n-BuLi于正己烷的溶液, 并将混合物再搅拌10分钟。然后, 在3分钟内逐滴加入悬浮在5ml THF中的0.407g 化合物 (XII-2)。将混合物在<-85℃下再搅拌30分钟。经过1.5h, 将混合物温热至0℃, 然后使其在室温下静置过夜。将固体抽滤出并用二氯甲烷洗涤。将滤液减压浓缩, 并将残余物通过MPLC在硅胶上使用流动相乙酸乙酯/甲醇 (95:5) 进行纯化。这得到200mg 产品 (70% 纯), 将其通过RP-HPLC (乙腈/水+0.1% 甲酸) 进一步纯化。纯化得到105mg (理论值的12.8%)。

[0551] $\log P[a]: 1.26; \log P[n]: 1.46$

[0552] $^1\text{H-NMR}$ ($d_6\text{-DMSO}$, 400MHz); $\delta = 2.31$ (s, 6H), 3.41 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 6.46 (s, 1H),

7.06 (s, 1H), 7.43-7.46 (m, 1H), 7.85-7.87 (m, 1H), 8.46-8.49 (m, 2H) ppm。

[0553] 制备1-苄基-N-甲基-N-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-5-羧酰胺(化合物XV-2)

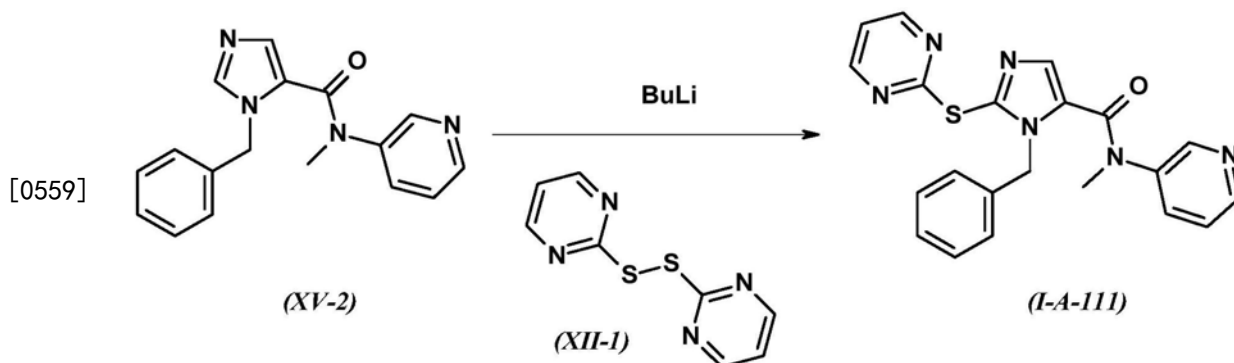


[0555] [根据Tetrahedron2004,60,6079-6083的步骤制备1-苄基-1H-咪唑-5-羧酸盐(XIII-2)]将1.00g (4.94mmol) 1-苄基-1H-咪唑-5-羧酸盐(XIII-2)溶解在10ml具有一滴二甲基甲酰胺的二氯甲烷中。逐滴加入0.475ml (5.44mmol) 草酰氯。将混合物在室温下搅拌3h。减压蒸发溶剂。向残余物中逐滴加入0.535g (4.94mmol) N-甲基吡啶-3-胺(V-1)于7.2ml吡啶的溶液,并将混合物在100℃下搅拌过夜。减压蒸发溶剂。将残余物溶解在8.3ml二氯甲烷中,并加入1.57g (14.8mmol) 碳酸钠。将混合物在室温下搅拌3h,然后过滤并浓缩。将残余物通过MPLC在硅胶上使用流动相乙酸乙酯/甲醇进行纯化。纯化得到0.326g (理论值的21.9%)。

[0556] $\log P[a]: 0.85; \log P[n]: 1.40;$

[0557] $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO, 400MHz); $\delta = 3.26$ (s, 3H), 5.45 (s, 2H), 6.27 (s, 1H), 7.19-7.21 (m, 2H), 7.30-7.42 (m, 5H), 7.858-7.863 (m, 1H), 7.90 (s, 1H), 8.40-8.41 (m, 1H) ppm。

[0558] 实施例(I-A-111): 1-苄基-N-甲基-N-(吡啶-3-基)-2-(嘧啶-2-基硫基)-1H-咪唑-5-羧酰胺



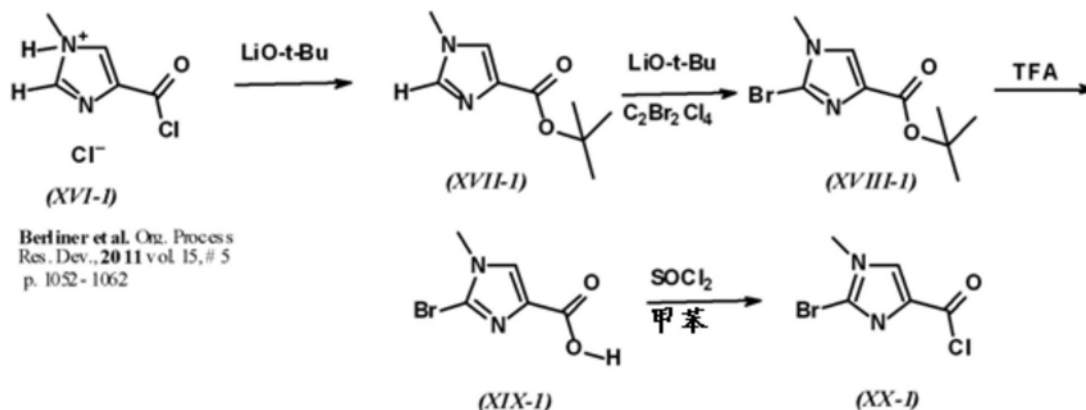
[0560] 将0.272g (0.930mmol) 1-苄基-N-甲基-N-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-5-羧酰胺(XV-2)溶解在11ml THF中,并冷却至-90℃。在反应期间,将温度保持在-85℃至-90℃。在-90℃下,在5分钟内逐滴加入0.39ml (0.977mmol) 2.5摩尔n-BuLi于正己烷的溶液,并将混合物再搅拌5分钟。随后,在5分钟的时间内,逐滴加入溶解在1ml THF中的0.620g 2,2'-二硫烷二基嘧啶(2.79mmol) (XII-1)。将混合物在-80℃下再搅拌30分钟,然后,在30分钟内温热至室温。用半浓缩的碳酸氢钠溶液/二氯甲烷萃取混合物。将水相用二氯甲烷萃取3次以上。将有机相合并,用少量水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并浓缩。将残余物通过MPLC在硅胶上使用流

动相乙酸乙酯/甲醇进行纯化。将所需馏分通过HPLC在RP18上使用流动相乙腈/水进行纯化。纯化得到140mg (理论值的35.1%)。

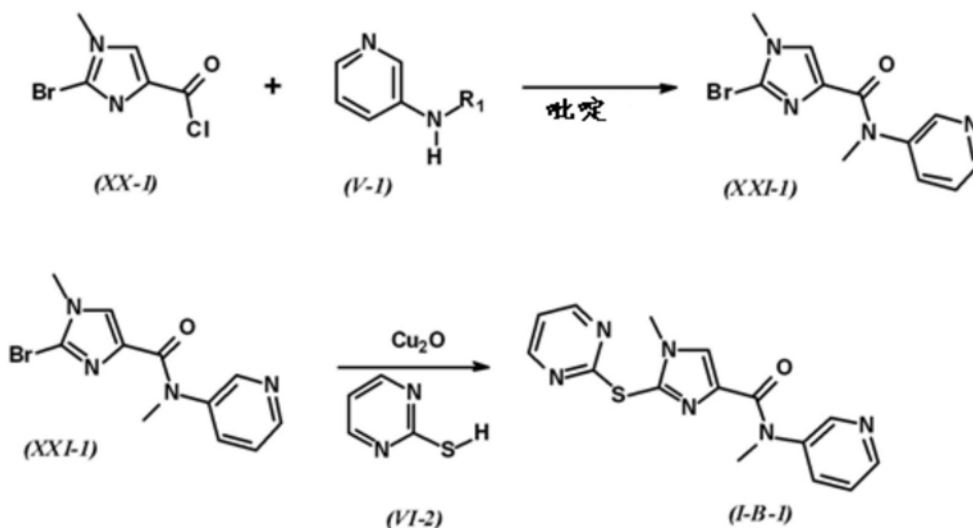
[0561] 分析见表2

[0562] 方法E

[0563] 实施例(I-B-1)



[0564]



[0565] 制备化合物(XVII-1)

[0566] 在氩气下且在 -40°C 下,将33.9g (0.493mol)叔丁醇锂在搅拌下加入36.5g (0.201mol) 1-甲基-1H-咪唑-4-碳酰氯盐酸盐于400ml四氢呋喃的悬浮液中。无需进一步冷却,然后将混合物搅拌12h。在加入170g碳酸氢钠之后,将混合物通过少量硅胶过滤,用乙酸乙酯洗涤。将合并的有机相蒸发,并将获得的残余物用二氯甲烷萃取。使二氯甲烷相的蒸发残余物分配在饱和碳酸氢钠溶液和乙酸乙酯之间,并将有机相经硫酸镁干燥、过滤并蒸发,得到22.7g 1-甲基-1H-咪唑-4-羧酸叔丁酯(理论值的73%产率)。

[0567] $\log P[a]: 0.74$;

[0568] $^1\text{H-NMR}$ (CD_3CN , 400MHz); $\delta = 1.52$ (s, 9H), 3.66 (s, 3H), 7.43 (s, 1H), 7.54 (s, 1H) ppm。

[0569] 制备化合物(XVIII-1)

[0570] 在室温下,首先将0.5g (2.744mmol) 1-甲基咪唑-4-羧酸叔丁酯(XVII-1)加入10ml四氢呋喃(THF)中,加入0.894g (2.744mmol) 1,2-二溴-1,1,2,2-四氯乙烷,并加入0.88g

(11mmol)叔丁醇锂。将混合物在室温下搅拌过夜,减压浓缩反应产物,并将残余物通过MPLC在RP18上使用乙腈/水+0.1%甲酸作为流动相进行纯化。产量:250mg(理论值的34.8%)。

[0571] $\log P[a]: 1.27$

[0572] $^1\text{H-NMR}$ (CD_3CN , 400MHz); $\delta = 1.51$ (s, 9H), 3.60 (s, 3H), 7.65 (s, 1H) ppm。

[0573] 制备化合物(XIX-1)

[0574] 在室温下,将645mg (2.47mmol) 2-溴-1-甲基-1H-咪唑-4-羧酸叔丁酯在1.7g三氟乙酸和7ml二氯甲烷的混合物中搅拌12小时。除去溶剂。所获得的蒸发残余物包含95%目标产物2-溴-1-甲基-1H-咪唑-4-羧酸,这相当于实际的定量收率。

[0575] $\log P[a]: 0.0$;

[0576] $^1\text{H-NMR}$ (CD_3CN , 400MHz); $\delta = 3.65$ (s, 3H), 7.78 (s, 1H) ppm。

[0577] 制备化合物(XXI-1)

[0578] 将0.32ml草酰氯(1.2当量)逐滴加入681mg (3.32mmol) 2-溴-1-甲基-1H-咪唑-4-羧酸于7ml二氯甲烷和3滴二甲基甲酰胺的溶液中。在4小时之后,将混合物蒸发至干燥物。向残余物中加入10ml二氯甲烷、359mg (1当量) N-甲基吡啶-3-胺和6当量N,N-二异丙基乙胺,然后将混合物搅拌1小时。然后将混合物蒸发至干燥物,并将残余物通过MPLC在硅胶上使用流动相乙酸乙酯/甲醇进行层析。产量411mg(理论值的43%)。

[0579] $\log P[n]: 0.76$;

[0580] $^1\text{H-NMR}$ (CD_3CN , 400MHz); $\delta = 3.41$ (s, 3H), 3.51 (s, 3H), 7.28-7.35 (m, 2H), 7.59-7.61 (m, 1H), 8.37-8.43 (m, 2H) ppm。

[0581] 制备化合物(I-B-1)

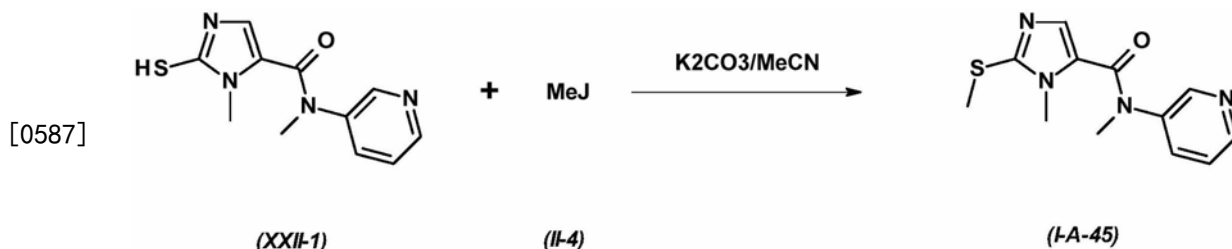
[0582] 将250mg (0.618mmol) 化合物(XXI-1)和69mg (0.618mmol) 2-巯基嘧啶在轧制法兰容器(rolled flange vessel)中合并,并在150℃下搅拌2h。将混合物用饱和EDTA溶液洗涤,并用乙酸乙酯萃取3次。有机溶液经硫酸镁干燥,过滤并在减压下浓缩。将残余物通过MPLC在硅胶上使用乙酸乙酯/甲醇梯度作为流动相进行纯化。产量:65mg(理论值的30.6%)。

[0583] $\log P[a]: 0.42$; $\log P[n]: 0.83$;

[0584] $^1\text{H-NMR}$ (CD_3CN , 400MHz); $\delta = 3.47$ (s, 3H), 3.58 (s, 3H), 7.15 (m, 1H), 7.30 (br. s, 1H), 7.54 (br. s, 1H), 7.60 (br. d, 1H), 8.39 (br. s, 2H), 8.48-8.49 (m, 2H) ppm。

[0585] 方法F

[0586] 实施例(I-A-45)

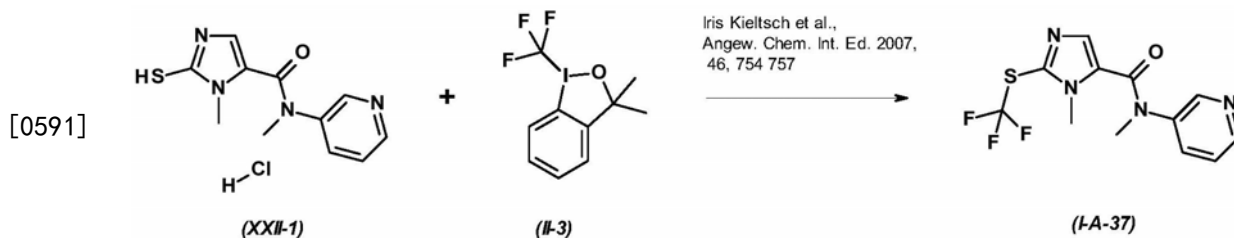


[0588] 在氩气下,将0.496g (2mmol) 化合物(XXII-1)、0.332g (2.4mmol) 碳酸钾和0.125ml (2mmol) 碘甲烷于10ml乙腈中回流沸腾1h。将反应混合物减压浓缩,加入碳酸氢钠溶液,将混合物再次浓缩,将残余物与乙醇搅拌,过滤出盐并将溶剂蒸发。反相色谱法之后,由残余

物得到237mg目标化合物(I-A-45)。

[0589] 分析见表2

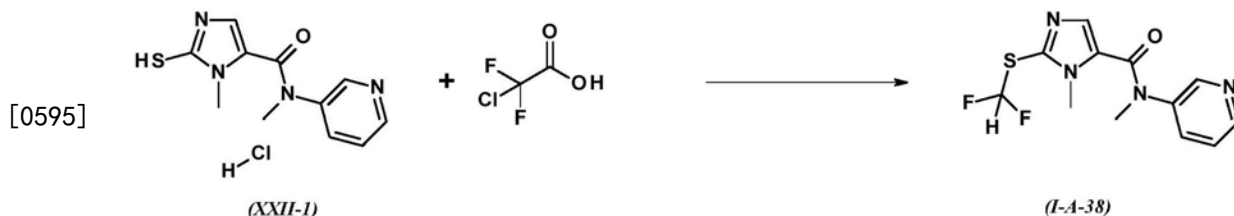
[0590] 实施例(I-A-37)



[0592] 在氩气下,将0.420g (1.47mmol) 化合物(XXII-1) 盐酸盐溶解在5ml甲醇中,并将混合物冷却至-78℃。加入烷基化试剂(II-3) (2当量) 之后,将混合物搅拌1小时,然后温热至室温,加入1ml饱和氯化铵溶液并将混合物完全浓缩。在硅胶上进行色谱法之后,由残余物得到220mg目标化合物(I-A-37)。

[0593] 分析见表2

[0594] 实施例(I-A-38)

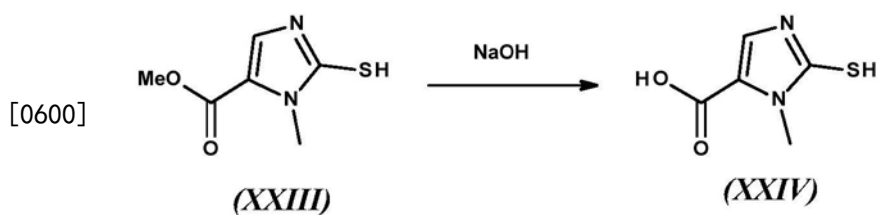


[0596] 将0.200g (0.70mmol) 化合物(XXII-1) 盐酸盐溶解在10ml二甲基甲酰胺中,并搅拌加入3当量碳酸钾和2当量氯二氟乙酸钠。在95℃下加热3小时之后,使混合物冷却至室温并完全浓缩,将残余物溶于10ml甲醇中,并将混合物通过Celite过滤。将滤液完全浓缩并在硅胶上层析,得到56mg目标化合物(I-A-38)。

[0597] 分析见表2

[0598] 化合物(XXII-1) 的合成路线

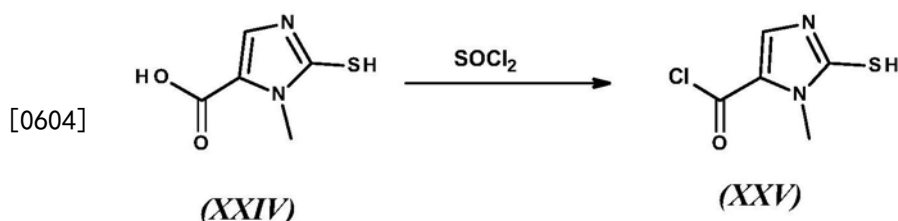
[0599] 化合物(XXIV)



[0601] 在15℃下,将428g (2.49mol) 市售可得的化合物(XXIII) 在2.8l的3M氢氧化钠水溶液中搅拌30min。然后使用6M盐酸将pH调节至1-2,并将沉淀物抽滤出。干燥得到363g化合物(XXIV)。

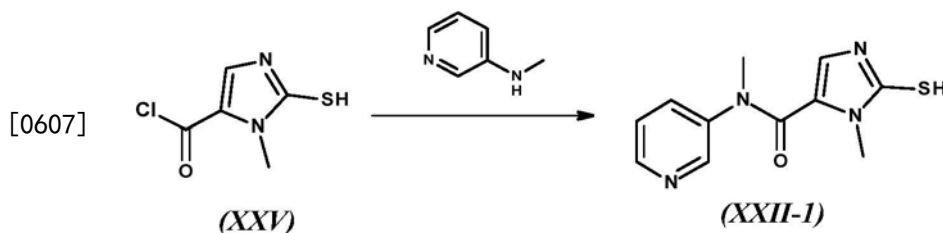
[0602] $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CD_3OD) : δ 3.82 (s, 3H) , 7.58 (s, 1H)

[0603] 化合物(XXV)



[0605] 首先将400g (2.53mol) 化合物 (XXIV) 加入3.2L二氯甲烷和30ml二甲基甲酰胺中。逐滴加入1.2L亚硫酰氯,然后将混合物在50℃下搅拌2小时。减压浓缩反应混合物。这得到580g固体形式的粗产物,将其直接用于下一反应。

[0606] 化合物 (XXII-1)

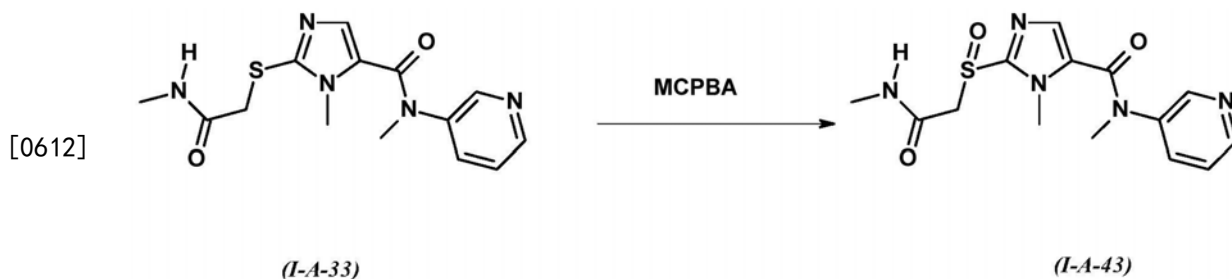


[0608] 在90℃下,将106g (601mmol) 化合物 (XXV) (1.3当量) 和50g (462mmol) 3-甲基氨基吡啶 (1当量) 在750ml吡啶中搅拌1h。然后减压浓缩反应混合物,并将残余物在硅胶上使用100:1至5:1的二氯甲烷/甲醇梯度进行纯化。这得到67.3g化合物 (XXII-1)。

[0609] $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , 400MHz) ; = 3.43 (s, 3H) , 3.61 (s, 3H) , 6.76 (s, 1H) , 7.81-7.84 (m, 1H) , 8.33 (d, 1H) , 8.67 (d, 1H) , 8.91 (d, 1H) 。

[0610] 方法G

[0611] 实施例 (I-A-43)



[0613] 将0.18g (0.564mmol) 化合物 (I-A-33) 溶解在30ml二氯甲烷中,并在0℃下在搅拌下连续加入321mg (2.82mmol) 三氟乙酸和243mg (1.41mmol) 3-氯过氧苯甲酸。将反应混合物浓缩。在硅胶上使用乙酸乙酯/甲醇梯度进行色谱法,得到62mg目标化合物 (I-A-43)。

[0614] 分析见表2

[0615] 实施例 (I-A-83)



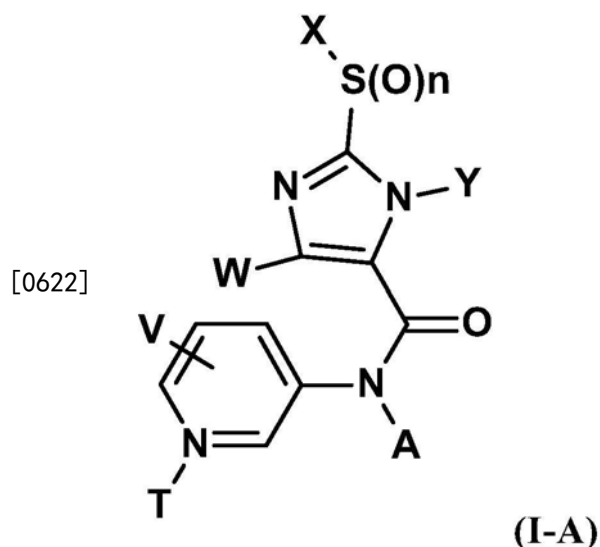
[0617] 将0.100g (0.29mmol) 化合物(I-A-62) 溶解在15ml二氯甲烷中,并在搅拌下连续加入5当量三氟乙酸和2当量3-氯过氧苯甲酸。在室温下搅拌24小时之后,加入另一当量的三氟乙酸,并且将混合物再搅拌一小时并几乎完全浓缩,RP色谱法之后得到59mg目标化合物(I-A-83)。

[0618] 分析见表2

[0619] 根据方法A至D、F和G以类似的方式制备的其他式(I)的化合物列于下表中。

[0620] 表1

[0621] 式(I-A)的化合物



[0623] 其中取代基具有表中所给的含义:

[0624]

实施例编号	X	n	W	Y	A	V	T
I-A-4	2-(4,6-二甲基)-嘧啶基-	0	H	CH ₃	H	H	电子对
I-A-5	正丁基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-6	正戊基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-7	苄基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-8	甲基	2	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-9	3-甲硫基苯基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-10	2,2,2-三氟乙基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-11	苯基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-12	4-甲基苯基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-13	2-嘧啶基-	0	Br	CH ₃	CH ₃	H	电子对

[0625]

I-A-14	乙硫基乙基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-15	2-嘧啶基-	0	Cl	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-16	2-硝基苯基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-17	环己基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-18	-(CH ₂) ₂ -O-CH ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-19	异丙基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-20	-(CH ₂) ₃ -O-CH ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-21	正丙基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-22	-(CH ₂) ₂ -O-C ₂ H ₅	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-23	-CH ₂ -CO-CH ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-24	-CH ₂ -CO ₂ -C ₂ H ₅	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-25	-CH ₂ -CO ₂ -CH ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-26	-(CH ₂) ₂ -S-CH ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-27	烯丙基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-28	-CH ₂ -CO-C(CH ₃) ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-29	-CH ₂ -CO ₂ H	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-30	炔丙基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-31	-CH ₂ -CO-环丙基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-32	-CH ₂ -CO-NH ₂	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-33	-CH ₂ -CO-NH-CH ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-34	-CH ₂ -CO-N(CH ₃) ₂	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-35	3,3-二甲基烯丙基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-36	乙基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-37	CF ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-38	CHF ₂	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-39	-CH ₂ -CNOCH ₃ -CH ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-40	乙基	2	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对

[0626]

I-A-41	乙基	0	H	CH ₃	H	H	电子对
I-A-42	-CH ₂ -CO-NH-CH ₃	2	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-43	-CH ₂ -CO-NH-CH ₃	1	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-44	甲基	0	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	电子对
I-A-45	甲基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-46	-CH ₂ -CF ₂ -CF ₂ Cl	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-47	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-48	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ F	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-49	-CH ₂ -CF ₂ -CHF ₂	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-50	-(CH ₂) ₂ -S-CH ₂ -CF ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-51	4-四氢噻喃基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-52	4-四氢吡喃基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-53	-(CH ₂) ₂ -i C ₃ F ₇	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-54	3-氧杂环丁基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-55	5-氧杂-[3.3.0]-二环庚烷	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-56	2,4,5-三氯苯基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-57	4-氯苯基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-58	4-甲氧基苯基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-59	4-二甲基氨基苯基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-60	2,5-二氯苯基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-61	3-三氟甲基苯基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-62	4-氟苯基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-63	4-叔丁基苯基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-64	4-氯-3-三氟甲基苯基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-65	2-吡啶基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-66	3-氯苯基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对

[0627]

I-A-67	2-二甲基氨基氨基甲酰基苯基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-68	3-硝基苯基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-69	2-二甲基氨基磺酰基苯基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-70	5-(2-氯)-吡啶基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-71	2-氟苯基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-72	2-甲氧基苯基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-73	3-氯苯基-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-74	3-氯苯基-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-75	4-叔丁基苯基-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-76	4-叔丁基苯基-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-77	3,5-二氯-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-78	3,5-二氯-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-79	4-氯-3-三氟甲基苯基-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-80	4-氯-3-三氟甲基苯基-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-81	4-甲氧基苯基-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-82	4-氟苯基-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-83	4-氟苯基-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	氧
I-A-84	4-氟苯基-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-85	2-吡啶基-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-86	2-吡啶基-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-87	苯基-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-88	苯基-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-89	4-硝基苯基-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-90	4-硝基苯基-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-91	2-二甲基氨基氨基甲酰基苯基-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对

[0628]

I-A-92	2-二甲基氨基氨基甲酰基苯基-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-93	4-甲氧基苯基-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-94	2-(5-氟)吡啶基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-95	3-三氟甲基苯基-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	氧
I-A-96	3-三氟甲基苯基-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-97	2-嘧啶基-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-98	2-嘧啶基-	0	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	电子对
I-A-99	2-嘧啶基-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-100	2-(4-三氟甲基)嘧啶基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-101	2-(4-甲基)-嘧啶基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-102	2-(4,6-二甲氧基)-嘧啶基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-103	2-(4,5-二甲基)-嘧啶基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-104	2-(5-甲基)-嘧啶基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-105	2-(5-三氟甲基)-嘧啶基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-106	2-(4-甲氧基)-嘧啶基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-107	2-(5-氟)-嘧啶基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-108	2-(6-甲基)-吡啶基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-109	2-(5-甲基)-吡啶基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-110	2-(3-三氟甲基)-吡啶基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-111	2-嘧啶基-	0	H	苄基	CH ₃	H	电子对
I-A-112	-CH ₂ -2-嘧啶基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-113	-CH ₂ -2-吡嗪基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-114	-CH ₂ -5-(1-甲基)咪唑基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-115	-CH ₂ -3-(1-甲基)吡唑基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-116	-CH ₂ -4-吡啶基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对

[0629]

I-A-117	-CH ₂ -2-吡啶基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-118	-CH ₂ -2-(1-甲基)咪唑基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-119	-CH ₂ -3-吡啶基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-120	-CH ₂ -2-呋喃基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-121	3,4-二氯苄基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-122	-CH ₂ -5-(2-氯)-吡啶基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-123	2,6-二氟苄基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-124	2-氟-6-甲氧基苄基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-125	2,6-二氯苄基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-126	2-氯-6-三氟甲基苄基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-127	2-氯-6-氟苄基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-128	-CH ₂ -2-(4,6-二甲氧基)- 嘧啶基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-129	2,6-二甲基苄基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-130	苄基	1	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-131	-CH ₂ -1-(3-硝基-5-甲 基)-吡唑基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-132	-CH ₂ -CO-NH-环丙基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-133	-CH ₂ -CONH--C(CH ₃) ₂ - CO ₂ CH ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-134	2-(1-甲基)-苯并咪唑基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-135	2-(5-甲基)-噁二唑基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-136	2-[3-甲基-6-(三氟甲基)- 咪唑并[4.5]-吡啶基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-137	3-[4-乙基-5-(三氟甲 基)]-1,2,4-三唑基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
I-A-138	3-[4-甲基-5-(三氟甲 基)]-1,2,4-三唑基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对

[0630]	I-A-139	3-[4-甲基-5-(二氟甲基)]-1,2,4-三唑基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
	I-A-140	2-(5-苯基)-1,3,4-噻二唑基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
	I-A-141	2-(1-甲基-5-苯基)-咪唑基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
	I-A-142	2-(4,5-二甲基)-噁唑基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
	I-A-143	2-(1-甲基-5-甲氧基羰基)-咪唑基	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
	I-A-144	2-(1-甲基)-咪唑基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
	I-A-145	1,2-乙烷二基-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	电子对
	I-A-146	2-噻啉基-	0	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	电子对

[0631] 表2

[0632] 表1中所列的化合物的分析数据

[0633] 从实施例1-A-17起,NMR数据使用NMR峰列表方法汇编。

[0634] 所选实施例的¹H NMR数据以¹H NMR峰列表的形式说明。对于每个信号峰,首先列出以ppm计的δ值,然后在圆括号内列出信号强度。对于不同的信号峰值,一对δ值-信号强度数以分号彼此间隔列出。

[0635] 因此,一个实例的峰列表采用以下形式:

[0636] δ1 (强度1); δ2 (强度2);; δi (强度i);; δn (强度n)

[0637] 在以cm计的NMR谱图像实例中,尖锐信号的强度与信号的高度相关,并且示出了信号强度的真实比例。在宽信号的情况下,可示出多个峰或中间信号及其相对于光谱中的最强信号的相对强度。

[0638] ¹H NMR谱的化学位移的校准使用四甲基硅烷和/或溶剂的化学位移来完成,特别是在DMSO中测量的光谱的情况下。因此,四甲基硅烷峰可以但并不必然在NMR峰列表中出现。

[0639] ¹H NMR峰列表类似于常规¹H NMR图像输出,因此,其通常包含在常规NMR解析中列出的所有峰。

[0640] 另外,类似于常规¹H NMR图像输出,其还可显示溶剂信号、目标化合物的立体异构体(其同样构成了本发明的主题的一部分)的信号,和/或杂质峰的信号。

[0641] 在溶剂和/或水的δ范围内记录的化合物信号中,我们的¹H NMR峰列表表示出标准溶剂峰,例如DMSO-D₆中的DMSO峰和水的峰,它们通常具有平均较高的强度。

[0642] 目标化合物的立体异构体的峰和/或杂质的峰通常具有比目标化合物(例如,纯度>90%)的峰平均更低的强度。

[0643] 这些立体异构体和/或杂质可为特定的制备方法所特有的。因此,在这种情况下,对照“副产物指纹图谱”它们的峰可有助于识别我们的制备方法的再现性。

[0644] 如果需要,专业人员通过已知方法(MestreC,ACD模拟,以及用经验估算的预期值)

计算目标化合物的峰,可任选地使用另外的强度滤波器来分离目标化合物的峰。这种分离类似于常规¹H NMR解析中的所述峰拾取。

[0645] ¹H NMR峰列表的其他细节可以见于Research Disclosure Database Number 564025。

[0646]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
I-A-4	1.55	1.97	¹ H-NMR (CD ₃ CN, 400 MHz); δ = 2.31 (s, 6H), 3.90 (s, 3H), 6.92 (s, 1H), 7.33-7.37 (m, 1H), 7.85 (s, 1H) 8.12-8.15 (m, 1H), 8.33-8.34 (d, 1H), 8.77 (br, 1H), 8.826-8.831 (d, 1H) ppm.
I-A-5	1.67	1.99	¹ H-NMR (CD ₃ CN, 400 MHz); δ = 0.87 (t, 3H), 1.34-1.42 (m, 2H), 1.53-1.61(m, 2H), 3.02-3.06 (m, 2H), 3.38 (s 3H), 3.70 (s, 3H), 6.24 (s, 1H), 7.35-7.38 (m, 1H), 7.66-7.69 (m, 1H) 8.407-8.413 (d, 1H), 8.45-8.47 (m, 1H) ppm.

[0647]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
I-A-6	2.03	2.33	¹ H-NMR (CD ₃ CN, 400 MHz); δ = 0.86 (t, 3H), 1.26-1.36 (m, 4H), 1.57-1.61(m, 2H), 3.02-3.06 (m, 2H), 3.38 (s 3H), 3,71 (s, 3H), 6.25 (s, 1H), 7.35-7.38 (m, 1H), 7.66-7.69 (m, 1H) 8.41-8.42 (d, 1H), 8.45-8.47 (m, 1H) ppm.
I-A-7	1.68	1.91	¹ H-NMR (CD ₃ CN, 400 MHz); δ = 3.37 (s 3H), 3,53 (s, 3H), 4.18 (s, 2H), 6.28 (s, 1H), 7.16-7.18 (m, 2H), 7.25-7.30 (m, 3H), 7.37-7.39 (m, 1H), 7.66-7.68 (m, 1H) 8.380-8.384 (m, 1H), 8.47-8.48 (m, 1H) ppm.
I-A-8	0.45	0.67	¹ H-NMR (CD ₃ CN, 400 MHz); δ = 3.25 (s 3H), 3,42 (s, 3H), 4.05 (s, 3H), 6.45 (s, 1H), 7.34-7.39 (m, 1H), 7.68-7.71 (m, 1H), 8.435-8.441 (d, 1H), 8.47-8.49 (m, 1H) ppm.
I-A-9	2.0	2.12	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO, 400 MHz); δ = 2.41 (s, 3H), 3.39 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 6.48 (s, 1H), 6.76 (d, 1H), 6.92-6.93 (m, 1H), 7.12-7.14 (m, 1H), 7.25 (t, 1H), 7.43-7.46 (m, 1H), 7.84-7.87 (m, 1H), 8.48-8.53 (m, 2H) ppm.
I-A-10	1.41	1.54	¹ H-NMR (CD ₃ CN, 400 MHz); δ = 3.39 (s 3H), 3,76 (s, 3H), 3.80-3.89 (q, 2H), 6.29 (s, 1H), 7.34-7.38 (m, 1H), 7.66-7.69 (m, 1H), 8.406-8.411 (d, 1H), 8.46-8.47 (m, 1H) ppm.
I-A-11	1.55	1.75	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO, 400 MHz); δ = 3.39 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 6.48 (s, 1H), 7.00-7.16 (m, 2H), 7.26-7.28 (m, 1H), 7.31-7.35 (m, 2H), 7.43-7.46 (m, 1H), 7.83-7.86 (m, 1H), 8.48-8.52 (m, 2 H) ppm
I-A-12	1.89	2.03	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO, 400 MHz); δ = 2,27 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 6.42 (s, 1H), 7.05-7.07 (m, 4H), 7.42-7.45 (m, 1H), 7.81-7.85 (m, 1H), 8.47-8.50 (m, 2 H) ppm

[0648]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
I-A-13	1.25	1.31	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO, 400 MHz); δ = 3.46 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 7.34-7.43 (m, 2H), 7.75-7.77 (m, 1H), 8.44-8.47 (m, 2H), 8.66-8.68 (m, 2 H) ppm
I-A-14	1.61	1.87	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO, 400 MHz); δ = 1.10-1.14 (t, 3H), 2.47-2.50 (m, 2H), 2.71-2.73 (m, 2H), 3.22-3.26 (m, 2H), 3.36 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 6.24 (s, 1H), 7.42-7.45 (m, 1H), 7.82-7.85 (m, 1H), 8.46-8.50 (m, 2H) ppm
I-A-15	1.24	1.34	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO, 400 MHz); δ = 3.45 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 7.35-7.43 (m, 2H), 7.76-7.78 (m, 1H), 8.44-8.47 (m, 2H), 8.67-8.68 (m, 2H) ppm
I-A-16	1.68	1.78	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO, 400 MHz); δ = 3.42 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 6.26 (d, 1H), 6.66 (s, 1H), 7.47-7.51 (m, 2H), 7.61-7.65 (m, 1H), 7.87-7.90 (m, 1H), 8.30-8.32 (m, 1H), 8.51-8.55 (m, 2 H) ppm
I-A-17	1.89	2.26	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.491(2.5);8.485(2.6);8.477(1.9);8.474(1.9);8.465(1.8);8.462(1.8);7.844(0.9);7.841(1.2);7.838(1.2);7.834(1.0);7.824(1.1);7.820(1.3);7.818(1.3);7.814(1.1);7.450(1.3);7.438(1.3);7.430(1.3);7.418(1.2);6.283(4.0);5.754(1.4);3.689(16.0);3.431(0.5);3.406(0.9);3.397(0.7);3.364(15.4);3.321(4.2);2.506(23.8);2.502(30.5);2.498(23.9);1.885(1.2);1.858(1.6);1.669(1.3);1.662(1.2);1.650(1.3);1.642(1.2);1.539(0.6);1.527(0.6);1.512(0.7);1.394(0.4);1.388(0.4);1.362(1.2);1.335(1.9);1.301(1.7);1.270(1.3);1.241(1.2);1.211(0.6);1.186(0.5);0.000(27.0)
I-A-18	0.76	1.14	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.502(1.8);8.495(1.8);8.484(1.2);8.481(1.3)

[0649]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ; δ (ppm)
			;8.473(1.2);8.469(1.3);7.857(0.6);7.854(0.8);7.851(0.8);7.848(0.7);7.837(0.7);7.833(0.8);7.831(0.9);7.827(0.7);7.460(1.0);7.448(1.0);7.440(0.9);7.428(0.9);6.230(3.2);3.677(12.9);3.504(1.7);3.488(4.1);3.473(2.2);3.361(12.2);3.325(12.0);3.240(2.1);3.224(3.9);3.209(16.0);3.166(0.8);2.525(0.3);2.508(16.1);2.503(21.6);2.499(16.3);0.008(0.4);0.000(11.1);-0.008(0.5)
I-A-19	1.23	1.53	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.491(2.1);8.485(2.2);8.478(1.6);8.474(1.7);8.466(1.6);8.462(1.6);7.847(0.8);7.843(1.0);7.841(0.9);7.837(0.8);7.827(1.0);7.823(1.1);7.820(1.1);7.817(0.9);7.452(1.1);7.440(1.2);7.431(1.1);7.419(1.0);6.295(3.7);3.702(15.9);3.597(0.4);3.580(1.1);3.563(1.5);3.547(1.1);3.530(0.5);3.368(14.9);3.318(18.5);2.510(12.4);2.506(23.6);2.502(30.4);2.497(22.5);1.244(16.0);1.227(15.8);0.000(5.4)
I-A-20	1.04	1.35	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.502(1.9);8.496(1.9);8.483(1.4);8.479(1.4);8.471(1.4);8.467(1.4);7.854(0.7);7.850(0.8);7.848(0.8);7.844(0.7);7.834(0.8);7.830(0.9);7.827(0.9);7.824(0.8);7.458(1.0);7.446(1.0);7.437(1.0);7.426(0.9);6.234(3.4);3.679(14.0);3.361(14.6);3.344(4.7);3.325(7.3);3.218(0.4);3.187(16.0);3.080(1.9);3.063(3.1);3.044(2.0);2.512(7.4);2.507(14.8);2.503(19.6);2.499(14.4);2.494(7.3);1.817(0.5);1.801(1.5);1.783(2.0);1.766(1.4);1.750(0.5);0.000(8.5);-0.008(0.4)
I-A-21	1.31	1.60	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.500(2.2);8.494(2.3);8.483(1.6);8.480(1.7);8.471(1.6);8.468(1.6);7.852(0.8);7.848(1.0);7.846(1.0);7.842(0.8);7.831(0.9);7.828(1.1);7.825(1.1);7.822(0.9);7.457(1.3);7.445(1.3);7.437(

[0650]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			1.2);7.425(1.1);6.230(4.0);3.677(16.0);3.361(15.2);3.320(9.3);3.034(2.5);3.016(4.2);2.999(2.6);2.687(0.4);2.674(0.5);2.507(13.7);2.502(18.1);2.498(13.6);1.596(1.4);1.578(2.7);1.560(2.7);1.542(1.5);1.524(0.3);0.922(4.2);0.904(8.3);0.885(3.8);0.000(7.6);-0.008(0.3)
I-A-22	1.04	1.41	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.499(2.2);8.493(2.2);8.484(1.6);8.480(1.6);8.472(1.6);8.468(1.6);7.853(0.8);7.849(1.0);7.846(1.0);7.843(0.8);7.832(0.9);7.829(1.1);7.826(1.1);7.822(0.9);7.458(1.2);7.446(1.2);7.438(1.1);7.426(1.0);6.232(4.0);3.680(16.0);3.537(2.1);3.521(4.8);3.506(2.5);3.417(1.4);3.399(4.4);3.382(4.5);3.361(15.2);3.311(8.2);3.229(2.4);3.213(4.6);3.197(2.0);2.511(7.8);2.506(15.6);2.502(20.5);2.498(14.9);2.493(7.4);1.080(4.5);1.063(8.9);1.045(4.3);0.008(0.4);0.000(10.1);-0.008(0.4)
I-A-23	0.67;0.71		¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.464(1.6);8.452(1.6);8.411(2.2);8.404(2.3);7.680(0.8);7.676(1.1);7.672(0.8);7.660(0.9);7.655(1.2);7.651(0.9);7.376(1.3);7.364(1.3);7.355(1.2);7.343(1.2);6.185(4.3);3.961(10.2);3.726(16.0);3.371(16.0);2.166(20.2);1.962(0.4);1.956(0.5);1.950(2.5);1.944(4.5);1.938(6.1);1.932(4.2);1.926(2.1);0.007(0.4);0.000(10.5);-0.001(10.5);-0.008(0.5)
I-A-24	1.20	1.34	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.468(1.4);8.464(1.5);8.456(1.5);8.452(1.5);8.412(2.0);8.406(2.1);7.687(0.8);7.683(1.0);7.680(0.9);7.677(0.8);7.666(1.0);7.662(1.1);7.660(1.1);7.656(0.9);7.377(1.2);7.365(1.2);7.357(1.1);7.345(1.0);6.224(3.9);4.102(1.4);4.084(4.0);4.067(4.1);4.049(1.4);3.820(10.7);3.738(16.

[0651]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			0);3.375(16.0);2.502(1.1);2.182(0.3);1.957(0.3);1.951(1.8);1.945(3.2);1.939(4.3);1.932(3.0);1.926(1.6);1.174(4.5);1.156(8.5);1.138(4.3);0.000(5.4)
I-A-25	0.88	1.09	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.471(1.3);8.468(1.3);8.459(1.3);8.456(1.3);8.411(1.8);8.405(1.8);7.688(0.8);7.684(0.9);7.682(1.0);7.678(0.8);7.668(0.9);7.664(1.0);7.661(1.0);7.658(0.8);7.380(1.0);7.368(1.0);7.360(0.9);7.348(0.8);6.220(3.4);3.836(9.5);3.734(16.0);3.692(0.3);3.665(0.5);3.660(0.5);3.623(14.8);3.432(0.5);3.389(1.0);3.377(15.4);2.500(2.2);2.135(0.4);2.126(0.4);2.118(0.5);2.112(0.5);2.105(0.5);2.099(0.4);1.962(0.8);1.950(10.0);1.944(18.1);1.938(24.1);1.932(17.0);1.926(8.9);0.008(1.3);0.000(31.4)
I-A-26	1.23	1.55	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.500(1.9);8.494(1.9);8.483(1.4);8.480(1.4);8.471(1.4);8.468(1.4);7.852(0.7);7.848(0.9);7.845(0.8);7.842(0.7);7.831(0.8);7.828(0.9);7.825(0.9);7.821(0.8);7.456(1.0);7.445(1.0);7.436(1.0);7.424(0.9);6.251(3.6);3.677(14.4);3.363(13.4);3.311(7.4);3.284(1.9);3.270(1.5);3.266(2.2);3.260(1.5);3.246(2.1);3.178(0.4);3.164(0.4);2.711(2.2);2.697(1.5);2.691(2.5);2.689(2.4);2.673(2.1);2.511(4.3);2.506(8.7);2.502(11.5);2.497(8.4);2.493(4.2);2.041(16.0);0.000(2.2)
I-A-27	1.08;1.11	1.40	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.463(1.4);8.460(1.5);8.451(1.5);8.448(1.5);8.400(2.0);8.394(2.1);7.673(0.8);7.669(1.0);7.666(1.0);7.663(0.8);7.652(0.9);7.648(1.1);7.646(1.1);7.642(0.9);7.374(1.2);7.362(1.2);7.353(1.1);7.342(1.0);6.264(3.9);5.911(0.6);5.904(0.3);5.893(0.3);5.886(0.9);5.869(1.0);5.861(0.4);

[0652]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			5.851(0.4);5.844(0.7);5.826(0.3);5.096(1.3);5.093(1.3);5.054(1.2);5.051(1.2);5.026(1.4);5.024(1.4);5.001(1.3);4.999(1.4);3.725(16.0);3.658(3.4);3.641(3.3);3.379(16.0);2.166(6.6);1.957(0.7);1.951(3.2);1.945(5.8);1.939(7.6);1.933(5.3);1.926(2.8);0.000(7.0)
I-A-28	1.53	1.78	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.463(0.5);8.460(0.6);8.451(0.5);8.448(0.6);8.408(0.7);8.402(0.7);8.034(0.4);7.677(0.4);7.674(0.4);7.670(0.4);7.656(0.4);7.653(0.5);7.650(0.4);7.372(0.5);7.361(0.5);7.352(0.4);7.340(0.4);6.188(1.3);4.259(3.6);3.741(5.4);3.705(0.8);3.390(0.9);3.371(5.4);2.502(2.4);2.138(0.3);1.956(0.7);1.950(3.2);1.944(5.9);1.938(7.9);1.932(5.8);1.926(3.1);1.118(16.0);1.093(1.3);0.000(7.5)
I-A-29	0.28	1.05	¹ H-NMR(601.6 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.506(2.0);8.502(2.0);8.482(1.4);8.480(1.4);8.475(1.5);8.472(1.4);8.139(1.2);7.843(0.9);7.841(1.0);7.839(1.0);7.837(0.8);7.830(1.0);7.827(1.1);7.826(1.1);7.823(0.9);7.452(1.1);7.444(1.1);7.438(1.0);7.430(1.0);6.202(2.4);5.754(0.6);3.884(8.4);3.697(16.0);3.358(15.5);3.340(0.4);3.333(0.4);3.327(0.4);2.541(11.6);2.507(5.9);2.504(11.9);2.501(16.0);2.498(11.6);2.495(5.5)
I-A-30	0.87	1.22	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.469(1.5);8.466(1.5);8.457(1.5);8.454(1.5);8.412(2.0);8.406(2.0);7.689(0.8);7.685(1.0);7.682(1.0);7.679(0.8);7.668(1.0);7.665(1.1);7.662(1.1);7.658(0.9);7.380(1.2);7.379(1.1);7.368(1.2);7.367(1.1);7.360(1.1);7.359(1.0);7.348(1.0);7.347(1.0);6.302(3.7);3.781(6.1);3.775(6.1);3.757(16.0);3.386(16.0);2.466(1.4);2.459(2.6);

[0653]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			2.453(1.3);2.170(1.7);1.957(0.4);1.952(1.9);1.946(3.4);1.939(4.5);1.933(3.1);1.927(1.6);0.000(2.7)
I-A-31	0.97	1.28	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.466(1.3);8.463(1.4);8.455(1.3);8.451(1.4);8.404(1.8);8.398(1.9);7.682(0.7);7.678(0.9);7.676(0.9);7.672(0.8);7.661(0.9);7.658(1.0);7.655(1.0);7.651(0.8);7.378(1.1);7.366(1.1);7.357(1.0);7.345(0.9);6.202(3.5);4.107(10.4);3.737(15.9);3.384(0.4);3.373(16.0);2.354(0.4);2.129(45.1);2.107(1.3);2.096(1.5);2.085(0.6);2.078(0.7);2.066(0.4);1.963(3.4);1.957(8.8);1.951(47.5);1.945(87.0);1.939(117.5);1.933(82.7);1.927(43.6);1.774(0.5);1.767(0.7);1.761(0.5);0.901(1.0);0.893(3.1);0.875(5.6);0.864(3.5);0.856(0.9);0.008(2.1);0.000(65.6)
I-A-32	0.11	0.50	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.475(1.5);8.472(1.6);8.463(1.6);8.460(1.6);8.418(2.1);8.412(2.2);7.695(1.0);7.690(0.8);7.673(1.1);7.388(1.2);7.376(1.2);7.368(1.1);7.356(1.1);6.258(3.1);3.734(10.9);3.654(9.4);3.383(16.0);3.280(0.7);3.269(0.7);2.149(58.1);2.119(0.5);2.113(0.6);2.106(0.7);2.101(0.5);1.963(2.7);1.957(7.2);1.951(35.9);1.945(64.9);1.939(86.7);1.933(60.5);1.927(31.8);1.774(0.4);1.768(0.5);1.762(0.4);0.007(1.3);0.000(34.8)
I-A-33	0.33	0.62	¹ H-NMR(600.1 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.472(1.1);8.470(1.1);8.464(1.2);8.462(1.1);8.4222(1.4);8.4216(1.4);8.418(1.5);7.691(0.7);7.689(0.8);7.687(0.8);7.685(0.7);7.678(0.7);7.675(0.8);7.673(0.8);7.671(0.7);7.382(0.9);7.381(0.9);7.374(0.9);7.373(0.9);7.368(0.9);7.367(0.8);7.360(0.8);7.359(0.8);6.245(2.1);3.719(16.0);3.652(7.8);3.380(15.5);2.613(6.4);2.605(6.0)

[0654]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ; δ (ppm)
			4);2.195(14.1);1.949(1.7);1.945(3.1);1.941(4.5);1.937(3.0);1.932(1.5)
I-A-34	0.59	0.81	¹ H-NMR(400.0 MHz, CD ₃ CN): δ = 8.464(1.6);8.453(1.6);8.414(2.2);8.408(2.3);7.684(1.1);7.680(0.9);7.664(1.2);7.660(1.0);7.381(1.3);7.369(1.3);7.360(1.2);7.348(1.1);6.228(4.1);4.009(9.2);3.743(16.0);3.378(16.0);3.014(0.4);2.950(14.7);2.867(0.4);2.848(13.5);2.170(28.7);1.963(1.0);1.952(12.6);1.946(23.5);1.940(32.2);1.934(23.6);1.928(12.9);0.000(7.7)
I-A-35	1.61	1.96	¹ H-NMR(400.0 MHz, CD ₃ CN): δ = 8.469(1.3);8.466(1.4);8.457(1.4);8.454(1.4);8.410(1.9);8.404(1.9);7.693(0.8);7.689(0.9);7.687(0.9);7.683(0.7);7.672(0.9);7.669(1.1);7.666(1.1);7.663(0.8);7.382(1.1);7.370(1.1);7.362(1.1);7.350(1.0);6.259(3.6);5.277(0.5);5.273(0.4);5.260(0.8);5.256(0.9);5.253(0.8);5.240(0.4);5.237(0.5);3.718(14.7);3.694(0.5);3.625(2.9);3.605(2.8);3.379(16.0);2.180(14.8);1.964(0.4);1.958(1.2);1.952(5.8);1.946(10.5);1.940(13.9);1.934(9.7);1.928(5.0);1.670(8.1);1.486(7.9);0.000(4.5)
I-A-36	0.95	1.31	¹ H-NMR(400.0 MHz, CD ₃ CN): δ = 8.466(1.4);8.463(1.4);8.454(1.5);8.451(1.4);8.415(2.0);8.409(2.0);7.688(0.8);7.685(1.0);7.682(0.9);7.678(0.8);7.668(1.0);7.664(1.1);7.662(1.1);7.658(0.9);7.379(1.1);7.367(1.1);7.359(1.0);7.347(1.0);6.254(3.7);3.748(0.8);3.703(15.9);3.380(16.0);3.069(1.3);3.051(3.9);3.033(4.0);3.014(1.4);2.759(1.5);2.193(4.9);2.119(0.4);2.113(0.4);2.107(0.4);1.963(1.1);1.952(9.8);1.946(17.1);1.940(22.3);1.933(15.6);1.927(8.2);1.322(0.5);1.269(0.4);1.259(4.2);1.241(8.1);1.223(4.0);0.000(3.5)

[0655]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ; δ (ppm)
I-A-37	1.29	1.45	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.501(2.4);8.494(2.5);8.483(1.7);8.480(2.0);8.472(1.8);8.468(2.0);7.864(1.0);7.861(1.3);7.858(1.4);7.854(1.2);7.844(1.1);7.840(1.4);7.838(1.5);7.834(1.2);7.450(1.5);7.438(1.5);7.429(1.4);7.418(1.3);6.592(1.4);3.867(16.0);3.402(17.1);3.372(1.4);3.321(15.5);2.506(21.8);2.502(29.3);2.498(23.9);1.621(1.7);1.236(0.8);0.000(6.0)
I-A-38	0.91	1.17	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.504(2.9);8.498(2.8);8.486(2.2);8.474(2.2);7.926(0.4);7.919(0.4);7.856(1.4);7.835(1.5);7.582(1.3);7.456(1.6);7.444(4.1);7.437(1.6);7.424(1.3);7.305(1.4);6.468(2.4);3.820(16.0);3.600(0.4);3.390(16.2);3.360(0.6);3.319(42.4);2.687(1.3);2.674(1.6);2.505(57.0);2.501(63.0);2.328(0.4);0.003(2.9);0.000(5.5)
I-A-39	1.13	1.37;1.45	¹ H-NMR(600.1 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.465(0.9);8.463(0.9);8.457(0.9);8.455(0.9);8.412(0.4);8.407(1.2);8.403(1.0);7.679(0.6);7.676(0.6);7.675(0.6);7.672(0.5);7.665(0.6);7.663(0.7);7.661(0.7);7.659(0.5);7.373(0.7);7.372(0.8);7.365(0.8);7.364(0.8);7.359(0.7);7.358(0.7);7.3513(0.7);7.3505(0.7);6.278(1.5);6.261(0.5);3.762(2.4);3.754(3.8);3.745(12.4);3.711(13.1);3.698(7.3);3.680(3.9);3.382(16.0);2.144(3.4);1.955(0.6);1.951(0.6);1.947(3.7);1.943(6.4);1.939(9.4);1.935(6.4);1.931(3.2);1.816(12.2);1.802(3.7);0.000(2.6)
I-A-40	0.68	0.88	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.479(1.5);8.476(1.6);8.467(1.6);8.464(1.6);8.431(2.0);8.426(2.1);7.695(0.8);7.692(1.1);7.689(1.1);7.686(1.0);7.675(1.0);7.671(1.2);7.669(1.2);7.665(1.0);7.379(1.2);7.367(1.3);7.358(

[0656]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			1.2);7.346(1.0);6.495(1.2);4.062(0.5);4.047(16.0);3.423(16.0);3.391(1.4);3.372(4.0);3.354(4.1);3.335(1.4);2.755(0.8);2.176(7.0);1.952(2.6);1.946(4.5);1.940(6.0);1.934(4.5);1.928(2.5);1.227(4.2);1.209(8.1);1.190(4.0);0.000(0.4)
I-A-41	0.71	1.54	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.815(2.1);8.810(2.1);8.651(0.8);8.316(1.6);8.304(1.7);8.139(1.1);8.118(1.2);7.742(4.4);7.365(1.2);7.353(1.3);7.344(1.2);7.333(1.1);3.804(16.0);3.206(1.3);3.188(3.9);3.170(4.0);3.151(1.3);3.033(0.4);2.154(170.7);2.113(2.4);2.107(2.2);2.101(1.6);1.951(60.2);1.945(107.1);1.939(142.1);1.933(100.9);1.927(53.4);1.779(0.4);1.774(0.7);1.768(0.9);1.761(0.6);1.755(0.4);1.357(4.1);1.339(8.0);1.320(3.9);0.146(3.0);0.000(555.3);-0.008(49.4);-0.150(3.0)
I-A-42	0.35	0.55	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.478(1.4);8.475(1.4);8.467(1.5);8.463(1.5);8.430(1.8);8.424(1.9);7.685(0.8);7.682(0.9);7.676(0.8);7.665(0.9);7.662(1.1);7.659(1.1);7.656(0.8);7.378(1.1);7.366(1.1);7.358(1.1);7.346(1.0);6.770(0.3);6.524(0.8);4.179(9.3);4.019(15.9);3.425(16.0);2.661(7.6);2.649(7.6);2.147(33.0);2.106(0.3);1.963(1.3);1.951(17.8);1.945(32.6);1.939(44.6);1.933(32.1);1.927(16.9);0.146(1.1);0.000(210.5);-0.008(16.6);-0.150(1.1)
I-A-43	0.27	0.22	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.480(1.8);8.470(1.8);8.427(2.3);8.421(2.4);7.703(1.2);7.682(1.3);7.389(1.3);7.377(1.4);7.369(1.3);7.357(1.1);6.727(0.5);6.439(1.9);5.446(0.4);4.167(1.9);4.132(2.9);4.010(3.4);3.998(16.0);3.975(2.0);3.816(0.5);3.413(15.8);3.389(0.6);2.652(7.8);2.640(7.7);2.178(4.7);1.951(4.6);1.945(8.2);1.939(11.1);1.933(8.2);1.927(4.4

[0657]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
);0.000(52.2);-0.001(52.2)
I-A-44	0.80	1.30	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.488(1.1);8.485(1.2);8.476(1.2);8.473(1.1) ;8.386(1.6);8.380(1.6);7.679(0.7);7.675(0.9);7. 672(0.9);7.669(0.7);7.658(0.9);7.655(1.0);7.65 2(1.0);7.648(0.8);7.395(1.0);7.383(1.0);7.375(0.9);7.363(0.9);7.345(0.5);6.170(3.7);4.608(0. 5);4.521(0.5);3.898(1.1);3.880(3.5);3.862(4.5); 3.844(1.2);3.801(1.1);3.687(15.5);2.499(16.0); 2.209(18.0);1.958(0.6);1.953(3.2);1.946(5.8);1 .940(7.8);1.934(5.4);1.928(2.8);1.162(3.7);1.1 44(7.4);1.126(3.6);0.008(0.6);0.000(13.5);-0.0 08(0.6)
I-A-45	0.54	1.04	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.814(2.0);8.809(1.8);8.600(1.4);8.586(1.4) ;8.392(1.0);8.389(1.0);8.370(1.1);8.368(1.0);7. 949(1.0);7.935(1.1);7.928(1.0);7.914(0.9);7.21 2(3.0);3.814(15.0);3.501(15.0);2.921(16.0);2.5 14(1.7);2.042(0.5);1.965(0.6);1.953(7.8);1.947 (14.0);1.941(18.5);1.935(12.7);1.928(6.5);0.00 0(49.4);-0.008(2.5)
I-A-46	2.09	2.17	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.502(1.4);8.498(1.5);8.490(1.4);8.486(1.4) ;8.445(1.9);8.439(1.9);7.715(0.8);7.711(0.9);7. 708(0.9);7.704(0.8);7.694(0.9);7.690(1.0);7.68 8(1.0);7.684(0.8);7.406(1.1);7.395(1.1);7.386(1.0);7.374(0.9);6.306(3.2);5.477(1.2);4.012(1. 5);3.970(2.6);3.969(2.6);3.927(1.6);3.809(1.1); 3.797(16.0);3.426(1.2);3.415(15.9);2.170(5.5); 1.994(0.4);1.988(0.8);1.982(4.0);1.976(7.1);1. 970(9.7);1.964(6.7);1.958(3.4)
I-A-47	1.65	1.84	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.506(1.3);8.502(1.4);8.494(1.4);8.490(1.4) ;8.453(1.9);8.447(1.9);7.724(0.8);7.720(0.8);7.

[0658]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			718(0.8);7.714(0.7);7.704(0.9);7.700(1.0);7.697(0.9);7.694(0.8);7.414(1.0);7.402(1.1);7.394(1.0);7.382(0.9);6.293(3.6);5.477(2.0);3.730(16.0);3.413(15.8);3.272(2.0);3.253(2.2);3.248(1.0);3.233(2.3);2.646(0.3);2.638(1.0);2.626(0.5);2.623(0.5);2.619(0.9);2.611(1.1);2.599(1.0);2.591(0.9);2.584(0.5);2.572(0.9);2.564(0.3);2.173(3.3);1.994(0.4);1.988(0.8);1.982(4.1);1.976(7.5);1.970(10.3);1.964(7.1);1.958(3.6)
I-A-48	1.11	1.40	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.497(1.4);8.495(1.6);8.486(1.5);8.483(1.6);8.446(2.2);8.440(2.2);7.718(0.8);7.714(1.0);7.708(0.8);7.697(0.9);7.693(1.1);7.409(1.2);7.397(1.2);7.388(1.1);7.376(1.1);6.282(4.1);5.478(2.5);4.594(1.3);4.579(2.5);4.565(1.3);4.475(1.3);4.461(2.5);4.446(1.3);3.741(16.0);3.410(16.0);3.181(2.4);3.163(4.4);3.145(2.6);2.204(17.0);2.078(0.3);2.063(0.8);2.045(1.2);2.028(0.8);2.013(0.6);1.995(1.1);1.982(5.2);1.976(9.0);1.970(11.4);1.964(8.6);1.958(4.2);1.948(0.4)
I-A-49	1.55	1.71	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ 8.501(1.9);8.498(1.7);8.489(1.6);8.486(1.3);8.444(2.3);8.438(2.0);7.714(1.1);7.710(1.2);7.708(1.1);7.704(1.0);7.694(1.2);7.690(1.2);7.684(0.8);7.407(1.4);7.396(1.4);7.387(1.2);7.375(1.0);6.305(3.4);6.278(0.4);6.268(0.6);6.146(0.8);6.136(1.3);6.125(0.6);6.014(0.4);6.004(0.6);5.478(3.9);3.826(1.6);3.796(16.0);3.784(3.0);3.742(1.7);3.414(15.2);2.198(8.5);2.194(8.2);1.982(6.0);1.976(8.6);1.970(10.0);1.964(6.5);1.958(3.1)
I-A-50	1.94	2.10	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ 8.498(1.4);8.495(1.4);8.486(1.4);8.483(1.4);8.446(2.0);8.440(2.1);7.720(0.7);7.716(0.9);7.714(0.9);7.710(0.8);7.699(0.9);7.695(1.1);7.693(1.0);7.68

[0659]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			9(0.9);7.409(1.2);7.397(1.1);7.388(1.0);7.376(1.0);6.276(3.9);5.478(0.8);3.730(16.0);3.410(15.9);3.344(1.2);3.318(5.8);3.300(2.6);3.292(4.3);3.280(2.6);3.266(1.3);2.936(1.9);2.917(2.2);2.899(1.6);2.195(17.4);1.995(0.4);1.988(0.7);1.983(4.5);1.976(8.3);1.970(11.5);1.964(8.0);1.958(4.1)
I-A-51	1.47	1.73	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ 8.493(1.3);8.489(1.3);8.481(1.4);8.477(1.4);8.437(1.8);8.431(1.9);7.706(0.8);7.702(0.9);7.700(0.8);7.696(0.7);7.686(0.9);7.682(1.0);7.679(0.9);7.676(0.8);7.403(1.1);7.391(1.1);7.382(1.0);7.370(0.9);6.328(3.7);5.478(3.9);3.762(16.0);3.505(0.5);3.487(0.5);3.479(1.0);3.470(0.5);3.452(0.5);3.429(0.4);3.414(15.8);2.686(2.4);2.677(4.9);2.663(2.7);2.655(1.9);2.628(0.3);2.261(0.4);2.251(0.8);2.241(0.9);2.229(0.6);2.218(1.2);2.208(1.2);2.181(4.9);1.994(0.4);1.988(0.7);1.983(4.1);1.976(7.6);1.970(10.5);1.964(7.2);1.958(3.7);1.806(0.5);1.793(0.5);1.781(0.6);1.772(0.9);1.760(0.7);1.747(0.9);1.738(0.6);1.724(0.4);1.712(0.4)
I-A-52	0.90	1.25	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ 8.488(1.7);8.477(1.7);8.436(2.4);8.430(2.5);7.708(0.8);7.706(1.0);7.704(1.1);7.700(0.9);7.688(0.9);7.686(1.1);7.684(1.3);7.680(1.0);7.401(1.4);7.390(1.4);7.381(1.3);7.369(1.2);6.329(4.3);5.478(1.8);5.477(1.6);3.894(1.0);3.885(1.7);3.876(1.1);3.865(1.2);3.856(1.9);3.846(1.1);3.769(16.0);3.768(15.2);3.617(0.6);3.607(0.3);3.600(0.6);3.590(1.3);3.580(0.6);3.573(0.4);3.562(0.6);3.434(1.4);3.429(1.5);3.416(16.0);3.414(15.2);3.406(2.8);3.400(2.4);3.377(1.2);3.372(1.2);2.199(18.1);1.993(0.4);1.983(4.0);1.982(4.0);1.977

[0660]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			(7.4);1.976(7.1);1.971(10.1);1.969(9.5);1.965(7.2);1.963(6.6);1.958(3.8);1.903(1.1);1.867(1.5);1.673(0.6);1.662(0.6);1.645(1.2);1.635(1.3);1.613(1.1);1.602(1.0);1.585(0.5);1.575(0.5)
I-A-53	2.68	2.76	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ 8.505(1.3);8.502(1.3);8.494(1.3);8.490(1.3);8.453(1.7);8.447(1.8);7.723(0.7);7.719(0.8);7.716(0.8);7.712(0.7);7.702(0.8);7.698(0.9);7.696(0.9);7.692(0.8);7.412(1.0);7.411(1.0);7.400(1.0);7.399(0.9);7.392(0.9);7.391(0.9);7.380(0.8);6.282(3.5);5.478(1.0);3.731(16.0);3.412(15.6);3.304(1.2);3.284(1.2);3.263(1.4);2.694(0.5);2.672(0.5);2.653(0.5);2.643(0.5);2.621(0.5);2.602(0.5);2.181(7.5);1.988(0.7);1.983(3.7);1.976(6.8);1.970(9.4);1.964(6.5);1.958(3.3)
I-A-54	0.63	0.98	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ 8.469(1.4);8.466(1.4);8.457(1.4);8.454(1.4);8.411(1.9);8.405(1.9);7.687(0.8);7.683(0.9);7.680(0.9);7.676(0.8);7.666(0.9);7.662(1.0);7.660(1.0);7.656(0.8);7.380(1.1);7.378(1.0);7.368(1.1);7.366(1.0);7.360(1.0);7.348(1.0);7.346(0.9);6.223(3.6);5.448(1.2);4.940(2.1);4.923(4.1);4.905(2.3);4.602(0.7);4.584(1.3);4.569(1.0);4.564(0.4);4.551(0.5);4.507(2.8);4.491(4.0);4.475(1.8);3.716(16.0);3.377(16.0);2.175(18.4);1.964(0.4);1.958(0.9);1.952(4.4);1.946(8.0);1.940(10.8);1.934(7.4);1.927(3.7);0.008(1.0);0.000(21.4);-0.008(0.7)
I-A-55	1.01	1.27	¹ H-NMR(601.6 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.632(0.5);8.629(0.5);8.546(0.4);8.539(0.4);8.486(2.2);8.481(2.2);8.478(1.7);8.475(1.5);8.470(1.6);8.467(1.4);7.842(0.8);7.840(1.0);7.838(0.9);7.836(0.8);7.829(0.9);7.826(1.0);7.825(1.0);7.822(0.8);7.448(1.1);7.440(1.1);7.434(1.

[0661]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			1);7.426(1.0);6.256(2.7);4.536(8.2);4.427(8.1); 4.244(0.7);3.900(3.3);3.790(1.2);3.778(1.8);3. 771(3.8);3.765(1.2);3.675(16.0);3.449(2.9);3.3 61(14.7);3.338(0.9);3.330(1.3);3.306(255.1);3. 280(0.3);3.173(0.7);3.164(0.7);2.660(1.3);2.65 5(0.7);2.646(1.4);2.642(1.3);2.637(1.5);2.628(0.7);2.624(1.4);2.615(1.0);2.612(1.3);2.609(0. 9);2.521(2.4);2.518(3.0);2.515(3.1);2.506(79.7);2.503(156.7);2.500(210.1);2.497(156.0);2.49 4(76.4);2.387(0.9);2.384(1.3);2.381(0.9);2.169 (1.5);2.165(0.7);2.157(1.5);2.152(1.3);2.147(1. 4);2.139(0.7);2.134(1.3);2.033(0.4);2.010(0.4); 0.000(1.3)
I-A-56	2.86	2.92	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.559(2.4);8.552(2.5);8.499(1.7);8.496(1.8) ;8.487(1.8);8.484(1.7);7.974(5.6);7.862(0.9);7. 858(1.1);7.855(1.0);7.852(0.9);7.841(1.1);7.83 7(1.2);7.835(1.2);7.831(1.0);7.452(1.4);7.440(1.4);7.431(1.3);7.420(1.2);6.721(5.0);6.558(2. 3);5.754(2.1);3.800(16.0);3.758(0.5);3.409(15. 5);3.318(23.4);2.671(0.4);2.507(46.4);2.502(6 0.3);2.498(45.2);2.329(0.4);1.989(0.5);0.008(2 .5);0.000(62.0)
I-A-57	2.02	2.14	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.515(2.4);8.509(2.6);8.495(1.7);8.493(1.8) ;8.484(1.7);8.481(1.8);8.135(1.5);7.855(0.9);7. 851(1.1);7.850(1.1);7.846(1.0);7.834(1.0);7.83 1(1.3);7.829(1.3);7.825(1.0);7.466(1.4);7.454(1.4);7.446(1.3);7.434(1.3);7.423(0.5);7.416(4. 3);7.399(1.6);7.394(4.9);7.115(0.6);7.108(4.8); 7.087(4.1);6.475(2.9);5.754(2.7);3.741(16.0);3 .392(15.6);3.321(2.5);2.507(15.4);2.503(20.1); 2.499(15.7);2.086(8.1);0.008(1.2);0.000(26.8)
I-A-58	1.62	1.79	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ

[0662]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			= 8.496(1.9);8.489(2.0);8.478(1.4);8.475(1.5);8.467(1.4);8.463(1.4);7.839(0.7);7.835(0.9);7.832(0.8);7.829(0.7);7.818(0.8);7.814(1.0);7.812(0.9);7.808(0.8);7.448(1.1);7.436(1.1);7.428(1.0);7.416(1.0);7.218(3.3);7.213(1.1);7.201(1.1);7.196(3.9);7.188(0.4);6.944(0.4);6.936(3.9);6.931(1.3);6.919(1.1);6.914(3.3);6.906(0.3);6.344(2.6);4.108(0.4);4.095(1.3);4.082(1.3);4.069(0.5);3.741(16.0);3.736(14.8);3.369(13.3);3.320(9.1);3.177(5.7);3.163(5.5);2.688(0.9);2.675(1.0);2.506(15.5);2.502(20.5);2.497(15.3);0.008(1.1);0.000(27.6);-0.009(1.1)
I-A-59	1.55	2.11	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ 8.486(1.2);8.480(1.3);8.469(0.9);8.466(0.9);8.458(0.9);8.454(0.9);8.140(1.9);7.830(0.5);7.827(0.6);7.824(0.6);7.821(0.5);7.810(0.5);7.806(0.6);7.804(0.6);7.800(0.5);7.441(0.7);7.429(0.7);7.421(0.6);7.409(0.6);7.180(2.0);7.175(0.8);7.158(2.1);6.676(2.0);6.654(1.9);6.263(1.7);3.732(8.0);3.357(9.0);2.891(16.0);2.506(13.5);2.502(17.4);2.498(13.4);2.073(0.7);0.007(0.9);0.000(16.4)
I-A-60	2.55	2.58	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.548(2.3);8.542(2.3);8.495(1.6);8.491(1.7);8.483(1.7);8.479(1.7);7.853(0.9);7.850(1.1);7.847(1.0);7.843(0.9);7.833(1.0);7.829(1.2);7.827(1.2);7.823(1.0);7.517(1.7);7.512(3.1);7.508(1.7);7.446(1.3);7.434(1.3);7.425(1.2);7.414(1.1);7.078(6.4);7.074(6.3);6.542(2.3);5.754(1.8);3.784(16.0);3.403(15.3);3.318(15.9);2.524(0.7);2.511(12.8);2.507(24.6);2.502(31.9);2.498(24.0);2.086(1.3);0.000(0.4)
I-A-61			¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.531(3.6);8.525(3.7);8.493(2.5);8.481(2.5)

[0663]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			;7.928(1.0);7.921(1.0);7.860(1.3);7.856(1.7);7.854(1.7);7.840(1.4);7.837(1.6);7.758(0.8);7.747(0.9);7.638(1.2);7.619(2.3);7.591(1.6);7.571(2.2);7.552(0.9);7.459(3.2);7.446(2.1);7.434(1.9);7.425(1.5);7.413(1.4);7.315(1.7);7.295(1.5);7.090(0.5);7.079(0.5);7.070(0.7);7.058(0.6);6.862(0.6);6.859(0.6);6.855(0.6);6.838(0.5);6.515(3.0);6.209(1.0);5.843(0.4);5.755(1.1);3.774(16.0);3.750(5.7);3.398(15.7);3.377(5.8);3.353(0.5);3.321(30.3);2.688(3.8);2.675(4.0);2.502(54.8);2.328(0.4);0.032(0.3);0.000(38.1)
I-A-62	1.66	1.87	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.509(2.4);8.503(2.6);8.489(1.8);8.486(1.8);8.477(1.9);8.474(1.8);7.929(0.4);7.923(0.4);7.849(0.9);7.845(1.2);7.843(1.2);7.839(1.0);7.828(1.1);7.825(1.3);7.822(1.3);7.819(1.0);7.762(0.3);7.751(0.3);7.458(1.4);7.446(1.4);7.438(1.3);7.426(1.3);7.222(10.5);7.207(5.0);7.202(5.1);7.186(0.3);7.179(0.4);6.427(3.0);5.755(3.7);3.747(16.0);3.384(15.4);3.323(5.6);2.689(1.3);2.677(1.4);2.507(16.7);2.503(20.8);0.008(0.9);0.000(18.4)
I-A-63	2.75	2.92	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.516(0.8);8.509(0.8);8.490(0.6);8.487(0.6);8.478(0.6);8.475(0.6);7.854(0.4);7.837(0.3);7.833(0.4);7.831(0.4);7.460(0.5);7.448(0.5);7.440(0.4);7.428(0.4);7.367(1.4);7.346(1.6);7.071(1.6);7.050(1.4);6.424(1.0);3.740(5.6);3.384(5.5);3.320(5.7);3.177(0.4);3.163(0.4);2.506(7.0);2.502(9.2);2.498(6.8);1.246(16.0);1.074(0.4);1.057(0.9);1.039(0.4);0.000(5.8)
I-A-64	2.63	2.71	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.526(2.8);8.520(2.9);8.493(2.2);8.482(2.2);7.854(1.5);7.852(1.4);7.834(1.6);7.832(1.5);7.

[0664]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			702(2.3);7.681(2.5);7.592(2.9);7.589(2.9);7.448(1.5);7.436(1.6);7.428(1.5);7.416(1.4);7.330(1.6);7.309(1.5);6.514(3.0);5.756(3.5);5.755(4.1);3.778(16.0);3.398(15.7);3.322(15.0);2.503(30.6);0.000(22.0)
I-A-65	1.01	1.18	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.535(2.3);8.529(2.4);8.505(1.6);8.502(1.7);8.493(1.7);8.490(1.7);8.397(1.3);8.387(1.3);8.384(1.3);7.878(0.8);7.874(1.0);7.873(1.0);7.869(0.9);7.858(1.0);7.854(1.1);7.852(1.1);7.848(0.9);7.727(0.8);7.722(0.8);7.707(1.4);7.703(1.5);7.688(0.9);7.683(0.9);7.479(1.3);7.468(1.3);7.459(1.3);7.447(1.2);7.229(1.1);7.217(1.2);7.211(1.2);7.198(1.0);6.814(2.0);6.794(1.9);6.542(2.2);3.753(16.0);3.414(15.4);3.320(14.3);2.507(21.1);2.502(27.9);2.498(21.2);0.008(0.6);0.000(13.8)
I-A-66	1.97	2.11	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.532(2.3);8.526(2.4);8.495(1.6);8.491(1.7);8.483(1.7);8.479(1.7);7.858(0.8);7.854(1.0);7.852(1.0);7.848(0.9);7.838(0.9);7.834(1.1);7.832(1.1);7.828(1.0);7.456(1.3);7.444(1.3);7.435(1.2);7.423(1.2);7.380(0.7);7.360(2.2);7.341(3.1);7.335(2.7);7.332(1.7);7.320(0.5);7.315(0.7);7.312(0.4);7.136(1.5);7.131(2.8);6.993(0.9);6.989(1.7);6.986(1.0);6.976(0.9);6.971(1.5);6.967(0.9);6.512(2.5);5.755(1.2);3.760(16.0);3.398(15.4);3.321(12.6);2.507(17.4);2.502(23.0);2.498(17.5);2.086(1.8);0.007(0.5);0.000(13.1)
I-A-67	1.17	1.25	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.513(2.1);8.506(2.2);8.490(1.5);8.487(1.6);8.478(1.5);8.475(1.5);8.137(1.7);7.859(0.8);7.855(1.0);7.853(1.0);7.849(0.9);7.839(1.0);7.835(1.1);7.832(1.1);7.829(0.9);7.460(1.3);7.448(

[0665]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			1.3);7.439(1.2);7.428(1.2);7.342(2.1);7.334(2.2);7.327(2.4);7.319(3.7);7.309(0.9);7.297(2.1);7.290(1.0);7.287(0.8);7.283(1.1);7.274(0.7);6.823(1.3);6.815(1.3);6.810(1.0);6.801(1.3);6.450(2.7);5.754(5.4);3.712(16.0);3.700(0.4);3.388(15.4);3.319(3.8);2.988(11.2);2.722(11.2);2.671(0.3);2.524(0.7);2.510(18.9);2.506(38.0);2.502(50.3);2.497(37.5);2.328(0.3);0.008(1.9);0.000(48.7);-0.008(2.3)
I-A-68	1.71	1.77	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.539(2.1);8.534(2.2);8.493(1.6);8.490(1.7);8.482(1.7);8.478(1.6);8.136(0.5);8.108(1.0);8.106(1.1);8.102(1.1);8.100(1.0);8.087(1.1);8.085(1.2);8.082(1.3);8.080(1.1);7.881(1.5);7.876(2.6);7.871(1.5);7.857(0.9);7.853(1.1);7.850(1.0);7.847(0.9);7.836(1.0);7.833(1.1);7.830(1.1);7.826(1.0);7.653(1.3);7.633(2.6);7.613(1.5);7.513(1.3);7.511(1.5);7.509(1.5);7.507(1.3);7.494(1.0);7.491(1.1);7.489(1.1);7.487(0.9);7.454(1.2);7.453(1.2);7.443(1.2);7.441(1.2);7.434(1.1);7.433(1.1);7.422(1.1);7.421(1.0);6.544(2.3);3.783(16.0);3.404(15.3);3.311(4.4);2.524(0.4);2.511(8.9);2.507(17.7);2.502(23.0);2.498(17.0);2.073(10.4);0.000(1.9)
I-A-69	1.56	1.63	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.529(1.0);8.522(1.1);8.513(0.7);8.510(0.8);8.502(0.8);8.498(0.8);8.151(0.3);7.886(0.4);7.882(0.5);7.880(0.5);7.876(0.4);7.866(0.5);7.862(0.5);7.859(0.5);7.856(0.5);7.851(0.7);7.847(0.7);7.831(0.8);7.828(0.8);7.528(0.3);7.513(0.6);7.510(0.6);7.494(0.5);7.489(0.8);7.476(0.6);7.467(0.5);7.455(0.6);7.451(0.6);7.448(0.6);7.429(0.8);6.598(1.0);6.354(0.8);6.334(0.7);5.754(1.0);3.708(7.2);3.414(6.8);3.318(4.7);2.815(

[0666]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			16.0);2.524(0.6);2.510(11.6);2.506(23.5);2.502(31.1);2.497(23.2);2.493(11.8);0.008(1.1);0.000(29.5);-0.008(1.3)
I-A-70	1.45	1.52	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.513(2.0);8.508(2.1);8.485(1.5);8.482(1.6);8.473(1.6);8.470(1.6);8.233(2.1);8.227(2.1);8.226(2.1);8.141(0.4);7.853(0.8);7.849(1.0);7.847(1.0);7.843(0.9);7.833(1.0);7.829(1.1);7.826(1.1);7.823(1.0);7.648(1.4);7.641(1.4);7.627(1.9);7.620(1.9);7.521(2.5);7.520(2.6);7.500(1.8);7.499(1.8);7.452(1.1);7.441(1.1);7.440(1.1);7.433(1.1);7.431(1.1);7.421(1.0);7.419(1.0);6.435(2.6);5.751(1.2);3.786(16.0);3.388(15.3);3.309(13.5);2.524(0.7);2.510(17.8);2.506(35.9);2.501(47.4);2.497(35.8);0.000(3.7)
I-A-71	1.68	1.78	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.513(2.5);8.507(2.4);8.498(0.9);8.487(2.1);8.484(2.1);8.475(1.7);8.472(1.6);7.855(1.2);7.851(1.3);7.849(1.3);7.845(1.3);7.835(1.3);7.831(1.3);7.828(1.2);7.825(1.0);7.456(1.7);7.444(1.6);7.435(1.5);7.423(1.2);7.397(0.4);7.392(0.5);7.383(0.6);7.376(1.0);7.358(1.1);7.354(0.8);7.344(0.6);7.340(0.5);7.312(1.1);7.309(1.1);7.292(0.9);7.288(1.5);7.285(1.1);7.267(0.7);7.264(0.6);7.188(1.1);7.185(1.1);7.169(1.7);7.166(1.6);7.151(0.9);7.147(0.8);6.920(0.9);6.916(1.0);6.900(1.6);6.896(1.5);6.881(0.7);6.877(0.7);6.438(2.9);6.237(0.4);3.779(3.2);3.767(16.0);3.674(1.6);3.400(3.2);3.389(15.6);3.373(0.4);3.360(1.6);3.322(3.5);3.311(12.5);3.037(0.4);2.510(27.1);2.506(37.5);2.501(41.6);2.497(28.4);0.858(0.5);0.840(0.9);0.821(0.4);0.011(0.5);0.000(2.8)
I-A-72	1.59	1.74	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ

[0667]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			= 8.522(3.3);8.492(2.4);8.481(2.4);7.867(1.6);7.847(1.8);7.467(1.5);7.455(1.7);7.447(1.5);7.435(1.3);7.249(1.0);7.229(2.2);7.210(1.3);7.051(2.7);7.031(2.2);6.879(1.3);6.860(2.5);6.841(1.3);6.475(3.7);6.421(2.3);6.402(2.2);5.754(1.3);3.819(16.0);3.732(16.0);3.398(15.7);3.321(8.9);2.502(36.3);0.000(2.8)
I-A-73	1.81	1.87	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.509(2.2);8.503(2.2);8.460(1.6);8.457(1.7);8.448(1.7);8.445(1.7);7.927(1.2);7.923(2.5);7.918(2.0);7.907(1.4);7.888(2.4);7.873(1.4);7.868(1.3);7.850(0.9);7.846(1.1);7.844(1.0);7.840(0.9);7.830(1.0);7.826(1.1);7.824(1.2);7.820(1.0);7.725(1.7);7.705(2.7);7.685(1.2);7.420(1.3);7.408(1.3);7.399(1.2);7.387(1.1);6.583(0.6);4.030(16.0);4.016(0.3);3.388(15.2);3.315(50.4);2.675(0.4);2.670(0.6);2.666(0.5);2.510(36.0);2.506(69.7);2.501(93.6);2.497(72.1);2.333(0.5);2.328(0.6);2.324(0.5);0.146(0.5);0.008(4.9);0.000(99.4);-0.008(4.9);-0.019(0.4);-0.150(0.5)
I-A-74	1.45	1.55	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.505(2.3);8.499(2.4);8.476(1.7);8.472(1.8);8.464(1.8);8.461(1.9);8.137(2.6);7.842(0.9);7.839(1.1);7.836(1.1);7.832(1.0);7.822(1.1);7.818(1.3);7.816(1.3);7.812(1.1);7.661(0.9);7.657(1.2);7.654(1.7);7.650(3.3);7.645(4.2);7.642(2.9);7.629(2.0);7.610(2.5);7.601(0.5);7.598(0.4);7.589(1.2);7.551(1.3);7.547(2.1);7.543(1.3);7.532(0.9);7.528(1.3);7.525(0.8);7.431(1.3);7.419(1.3);7.411(1.3);7.399(1.2);6.471(1.1);3.907(16.0);3.376(15.3);3.316(5.7);2.670(0.4);2.666(0.3);2.506(46.5);2.501(62.9);2.497(50.5);2.328(0.4);2.324(0.3);0.008(2.8);0.000(63.9)
I-A-75	2.14	2.19	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ

[0668]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			= 8.504(0.8);8.498(0.8);8.481(0.6);8.478(0.6);8.470(0.6);8.466(0.6);8.139(0.6);7.839(0.4);7.837(0.4);7.833(0.3);7.823(0.3);7.819(0.4);7.816(0.4);7.813(0.3);7.626(1.1);7.604(1.7);7.519(1.7);7.498(1.1);7.437(0.4);7.425(0.5);7.417(0.4);7.405(0.4);6.459(0.4);3.845(5.4);3.369(5.1);3.316(8.7);2.510(11.9);2.506(23.5);2.501(31.8);2.497(24.8);1.298(16.0);0.008(1.7);0.000(35.6);-0.008(1.8)
I-A-76	2.53	2.55	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.515(0.9);8.509(0.9);8.461(0.7);8.449(0.7);7.852(1.6);7.831(2.1);7.697(1.7);7.675(1.3);7.424(0.5);7.412(0.5);7.404(0.6);7.392(0.5);5.752(1.9);4.017(5.4);3.383(5.2);3.371(0.3);3.316(5.0);2.502(9.5);1.300(16.0);0.000(6.2)
I-A-77			¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.467(1.2);8.464(1.3);8.455(1.3);8.452(1.3);8.400(1.7);8.394(1.7);7.651(0.7);7.647(0.9);7.645(0.8);7.641(0.7);7.630(1.0);7.626(2.2);7.621(3.2);7.617(1.6);7.515(5.3);7.511(4.8);7.355(1.0);7.343(1.0);7.334(0.9);7.322(0.9);6.424(1.2);3.918(16.0);3.391(16.0);2.142(23.5);2.113(1.1);2.106(0.9);2.100(0.7);2.094(0.4);1.963(2.1);1.957(4.1);1.951(26.4);1.945(48.5);1.939(6.8);1.933(46.1);1.926(23.8);1.767(0.4);0.146(1.2);0.008(10.3);0.000(243.1);-0.009(11.1);-0.033(0.6);-0.150(1.2)
I-A-78	2.37	2.53	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.512(2.5);8.506(2.5);8.462(1.8);8.460(1.9);8.451(1.9);8.448(1.9);8.118(1.8);8.114(2.9);8.110(1.8);7.933(6.3);7.928(6.0);7.848(1.3);7.827(1.4);7.422(1.4);7.410(1.4);7.401(1.3);7.390(1.2);6.625(0.8);5.753(1.7);4.042(16.0);3.394(15.4);3.315(45.2);2.671(0.6);2.501(97.2);2.328(

[0669]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			0.7);0.000(22.3)
I-A-79	2.16	2.29	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.503(2.9);8.498(2.9);8.467(2.3);8.455(2.3) ;8.072(3.7);7.973(0.8);7.952(5.1);7.922(0.6);7. 845(1.5);7.824(1.7);7.425(1.5);7.413(1.6);7.40 5(1.5);7.393(1.4);6.450(1.5);5.752(3.7);3.985(16.0);3.380(15.6);3.313(43.1);2.891(0.7);2.731 (0.7);2.670(0.9);2.501(137.8);2.327(0.9);0.000 (30.9)
I-A-80	2.56	2.72	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.503(2.8);8.498(2.8);8.455(2.2);8.444(2.2) ;8.256(1.5);8.235(1.8);8.192(3.3);8.063(2.7);8. 042(2.2);7.848(1.5);7.829(1.6);7.419(1.5);7.40 7(1.6);7.399(1.4);7.387(1.3);6.604(0.9);4.043(16.0);3.390(15.6);3.314(43.1);2.671(0.8);2.501 (125.8);2.328(0.8);0.000(25.2)
I-A-81	1.53	1.58	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.506(2.4);8.500(2.5);8.463(1.7);8.460(2.0) ;8.451(1.8);8.448(1.9);7.861(4.1);7.852(1.6);7. 839(5.0);7.832(1.8);7.828(1.6);7.825(1.5);7.82 2(1.2);7.428(1.4);7.417(1.4);7.408(1.3);7.396(1.2);7.185(0.7);7.178(4.4);7.155(4.2);6.486(0. 9);5.754(4.5);4.002(15.6);3.862(16.0);3.820(0. 4);3.379(14.9);3.330(1.5);3.319(33.0);2.687(0. 7);2.674(1.0);2.506(54.0);2.502(71.2);2.497(5 7.9);2.328(0.5);2.086(3.8);0.008(2.6);0.000(38 .0)
I-A-82	1.53	1.62	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.506(1.8);8.501(1.9);8.460(1.5);8.448(1.4) ;8.314(0.5);8.027(2.0);8.014(2.1);8.009(1.5);8. 004(2.2);7.996(1.1);7.992(2.0);7.901(1.2);7.89 8(1.1);7.882(0.6);7.851(0.9);7.847(1.1);7.845(1.1);7.841(0.9);7.831(1.0);7.827(1.2);7.824(1. 2);7.821(1.0);7.530(2.3);7.508(4.0);7.486(2.0);

[0670]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ; δ (ppm)
			7.426(1.2);7.414(1.2);7.406(1.1);7.394(1.0);6.536(0.7);4.021(16.0);3.384(15.2);3.317(96.9);2.675(1.0);2.670(1.4);2.666(1.1);2.506(159.2);2.501(207.5);2.497(158.2);2.333(1.0);2.328(1.3);2.324(1.0);0.000(5.0)
I-A-83	1.12	1.23	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.464(2.9);8.136(0.9);8.132(1.6);8.126(1.1);8.123(1.1);8.119(1.6);8.114(1.0);8.058(2.1);8.053(1.0);8.045(2.3);8.040(1.5);8.035(2.4);8.027(1.1);8.023(2.3);7.543(2.3);7.521(4.3);7.503(0.8);7.499(2.1);7.421(0.4);7.417(0.4);7.401(4.9);7.389(2.2);7.368(0.4);6.788(3.0);4.099(0.9);4.085(0.9);4.072(0.3);4.032(16.0);3.348(15.6);3.323(27.4);3.176(3.4);3.163(3.3);2.507(23.5);2.503(30.9);2.498(23.6);0.000(0.5)
I-A-84	1.22	1.27	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.497(2.2);8.491(2.3);8.478(1.6);8.475(1.7);8.466(1.6);8.463(1.6);7.842(0.9);7.838(1.1);7.832(0.9);7.821(1.0);7.818(1.2);7.815(1.1);7.812(0.9);7.684(1.9);7.679(1.0);7.671(2.1);7.667(1.5);7.662(2.4);7.654(1.1);7.649(2.2);7.472(0.3);7.465(2.3);7.460(0.9);7.442(4.4);7.426(2.0);7.420(2.6);7.406(1.2);6.452(1.1);5.754(2.0);3.880(16.0);3.372(15.2);3.318(34.3);2.671(0.4);2.506(49.2);2.502(63.2);2.497(47.1);2.328(0.4);2.086(0.5);0.008(0.5);0.000(7.4)
I-A-85	1.01	1.10	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.744(1.4);8.742(1.2);8.736(1.0);8.733(1.6);8.730(1.1);8.514(1.9);8.508(2.0);8.461(1.4);8.458(1.6);8.449(1.5);8.446(1.6);8.208(0.4);8.204(0.5);8.189(1.4);8.185(1.4);8.172(3.3);8.168(3.7);8.153(0.5);8.151(0.5);7.854(0.8);7.851(1.0);7.848(1.0);7.844(0.9);7.834(1.0);7.830(1.1);7.828(1.1);7.824(0.9);7.790(0.9);7.785(0.9);7.

[0671]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ; δ (ppm)
			778(0.9);7.773(1.6);7.768(0.9);7.762(0.9);7.757(0.8);7.430(1.2);7.418(1.2);7.410(1.1);7.398(1.0);6.628(0.5);5.754(2.5);4.095(16.0);3.402(15.1);3.317(19.4);2.675(0.3);2.670(0.5);2.666(0.4);2.510(26.1);2.506(51.0);2.501(68.0);2.497(51.7);2.492(26.7);2.328(0.4);0.000(0.4)
I-A-86	0.59	0.80	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.591(1.8);8.581(1.8);8.501(2.6);8.495(2.8);8.474(2.1);8.462(2.1);8.171(0.8);8.155(1.7);8.152(1.9);8.136(4.8);8.035(2.5);8.016(1.8);7.839(1.3);7.835(1.2);7.819(1.5);7.815(1.2);7.584(1.3);7.573(1.4);7.566(1.3);7.554(1.2);7.439(1.5);7.427(1.5);7.419(1.5);7.407(1.3);6.433(1.3);3.857(16.0);3.370(16.0);3.320(3.9);2.671(0.4);2.501(55.8);2.329(0.4)
I-A-87	1.04	1.20	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.494(2.3);8.487(2.3);8.480(1.7);8.476(1.7);8.468(1.7);8.464(1.8);8.138(1.2);7.836(0.9);7.832(1.0);7.831(1.0);7.827(0.9);7.816(1.1);7.812(1.1);7.810(1.1);7.806(0.9);7.605(0.7);7.601(0.8);7.597(1.1);7.584(8.1);7.578(7.3);7.568(1.6);7.557(0.8);7.435(1.3);7.423(1.3);7.415(1.2);7.403(1.2);7.395(0.3);6.466(1.0);5.754(3.4);4.021(0.9);4.012(0.8);3.832(16.0);3.382(1.0);3.367(15.2);3.343(1.4);3.320(10.5);2.510(18.0);2.506(33.9);2.502(43.7);2.497(32.5);2.493(16.2);0.000(2.1)
I-A-88	1.37	1.47	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.507(2.2);8.500(2.2);8.460(1.6);8.457(1.6);8.448(1.7);8.445(1.6);7.927(2.9);7.908(3.5);7.847(0.9);7.843(1.1);7.838(0.9);7.827(1.0);7.822(1.2);7.817(1.0);7.809(0.7);7.790(1.9);7.772(1.2);7.691(2.6);7.671(3.6);7.652(1.5);7.420(1.3);7.408(1.3);7.400(1.3);7.388(1.2);6.544(0.7);

[0672]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			5.754(4.3);4.012(16.0);3.382(15.3);3.320(33.6);2.506(34.7);2.501(44.4);2.497(33.4);0.000(1.9);-0.001(2.0)
I-A-89	1.20	1.38	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.495(2.5);8.489(2.7);8.463(1.8);8.460(2.0);8.447(2.7);8.441(2.9);8.436(2.3);8.418(1.5);8.398(1.5);8.394(1.3);8.039(1.5);8.019(1.9);7.892(1.7);7.872(2.8);7.852(1.3);7.844(1.0);7.838(1.3);7.835(1.1);7.824(1.1);7.818(1.4);7.814(1.1);7.424(1.4);7.412(1.4);7.404(1.4);7.392(1.4);6.462(1.2);5.754(8.3);3.957(16.0);3.376(15.3);3.349(0.6);3.319(46.3);2.671(0.4);2.666(0.3);2.506(48.2);2.502(63.4);2.497(51.2);2.328(0.4);0.000(13.5)
I-A-90	1.58	1.68	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.610(1.4);8.606(1.5);8.604(1.5);8.589(1.4);8.586(1.6);8.584(1.7);8.550(2.9);8.502(2.3);8.497(2.4);8.449(1.9);8.438(1.9);8.377(1.7);8.357(1.8);7.988(1.6);7.968(2.8);7.948(1.3);7.848(1.3);7.845(1.4);7.827(1.4);7.825(1.5);7.418(1.4);7.406(1.4);7.397(1.4);7.385(1.2);6.610(0.8);5.754(10.9);4.049(16.0);3.387(15.5);3.330(29.8);2.670(0.5);2.501(69.6);2.328(0.5);0.000(11.9)
I-A-91	0.76	0.96	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.539(2.4);8.533(2.4);8.480(1.7);8.477(1.8);8.469(1.8);8.465(1.7);8.142(0.4);8.053(1.8);8.033(2.0);7.902(0.9);7.898(1.1);7.892(0.9);7.882(1.1);7.877(1.2);7.872(1.0);7.756(0.9);7.754(0.9);7.735(1.8);7.718(1.0);7.715(1.0);7.607(1.0);7.590(1.9);7.588(1.9);7.572(1.0);7.569(1.0);7.458(1.5);7.447(3.1);7.437(1.5);7.428(2.0);6.362(1.2);5.754(5.1);3.978(16.0);3.384(15.4);3.321(46.6);2.743(4.1);2.675(0.4);2.670(0.5);2.5

[0673]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			06(54.4);2.501(71.4);2.497(54.1);2.439(4.0);2.333(0.3);2.328(0.5);2.324(0.3);0.000(7.4)
I-A-92	1.12	1.29	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.522(2.3);8.516(2.3);8.453(1.8);8.443(1.8);8.134(1.2);8.034(1.8);8.014(2.1);7.839(1.3);7.819(2.1);7.802(2.0);7.783(1.3);7.710(1.3);7.691(1.9);7.673(0.8);7.455(2.1);7.436(1.9);7.416(1.4);7.404(1.4);7.396(1.3);7.384(1.3);6.548(0.7);5.754(6.4);3.986(15.8);3.395(15.4);3.321(3.7.3);2.958(16.0);2.670(0.5);2.646(14.9);2.506(45.7);2.502(58.2);2.498(45.4);2.329(0.4);0.000(4.4)
I-A-93	1.12	1.28	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.497(0.6);8.313(1.0);8.134(0.8);8.016(0.5);7.855(0.9);7.834(1.0);7.634(0.4);7.629(0.4);7.554(0.4);7.546(3.2);7.524(3.6);7.459(0.6);7.447(0.7);7.438(0.7);7.427(0.6);7.142(3.6);7.120(3.3);6.447(1.0);4.432(0.3);4.349(0.5);4.002(3.7);3.972(3.3);3.961(3.3);3.863(3.1);3.852(15.2);3.820(16.0);3.749(1.3);3.742(1.2);3.671(0.8);3.637(0.6);3.605(0.5);3.544(0.4);3.510(0.4);3.381(1.0);3.370(12.8);2.789(3.7);2.675(1.3);2.671(1.8);2.666(1.3);2.510(112.8);2.506(220.1);2.501(293.3);2.497(224.0);2.437(0.6);2.400(0.4);2.385(0.3);2.370(0.4);2.333(1.5);2.328(2.0);2.324(1.6);0.008(0.6);0.000(14.9);-0.008(0.6)
I-A-94	1.18	1.39	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.484(1.3);8.481(1.4);8.473(1.4);8.469(1.4);8.430(1.9);8.424(2.0);8.287(1.9);8.280(2.0);7.705(0.7);7.702(0.9);7.699(0.8);7.696(0.7);7.685(0.8);7.681(1.0);7.679(1.0);7.675(0.8);7.473(0.7);7.465(0.6);7.451(1.2);7.444(1.2);7.430(0.7);7.422(0.7);7.396(1.1);7.384(1.1);7.376(1.0);7.364(0.9);6.957(1.2);6.947(1.2);6.935(1.1);6.

[0674]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			925(1.1);6.487(2.5);5.447(5.3);3.779(16.0);3.423(15.8);2.763(0.7);2.751(0.7);2.165(8.4);1.958(0.5);1.952(3.2);1.946(5.8);1.940(7.9);1.934(5.4);1.927(2.8);0.008(0.7);0.000(17.4);-0.009(0.7)
I-A-95	1.41	1.39	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.449(2.9);8.138(0.9);8.134(1.7);8.129(1.1);8.124(1.1);8.120(1.7);8.116(1.0);8.020(2.5);7.984(1.2);7.965(1.6);7.941(1.2);7.921(1.8);7.854(1.4);7.834(1.9);7.815(0.8);7.419(0.5);7.415(0.4);7.398(4.7);7.383(2.0);7.362(0.5);6.740(3.7);5.755(8.3);3.962(16.0);3.375(0.4);3.340(15.9);3.320(34.9);2.671(0.4);2.506(49.1);2.502(64.8);2.497(49.9);2.328(0.4);0.008(0.8);0.000(16.2);-0.008(0.6)
I-A-96	1.74	1.80	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.502(2.4);8.496(2.4);8.468(1.7);8.465(1.9);8.456(1.8);8.453(1.9);7.971(3.7);7.955(1.6);7.915(1.1);7.895(1.8);7.841(2.1);7.823(2.6);7.814(1.2);7.803(0.6);7.539(0.4);7.422(1.4);7.410(2.1);7.402(1.3);7.390(1.3);6.807(0.8);6.457(1.0);5.754(1.7);3.953(16.0);3.774(2.5);3.375(15.4);3.364(2.8);3.349(0.6);3.318(96.5);2.675(0.7);2.671(0.9);2.666(0.7);2.506(102.8);2.501(134.3);2.497(102.4);2.333(0.6);2.328(0.9);0.008(1.5);0.000(31.3);-0.008(1.3)
I-A-97	0.45	0.48	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.661(6.4);8.649(6.5);8.423(2.7);8.163(0.9);8.159(1.1);8.156(1.1);8.153(1.6);8.146(1.3);8.141(1.0);7.436(2.6);7.427(4.1);7.424(3.8);7.340(1.7);7.328(3.2);7.316(1.7);6.802(4.7);3.740(16.0);3.380(15.7);3.320(12.1);2.506(21.1);2.502(28.0);2.498(21.3);1.236(0.5);0.008(0.9);0.000(26.2)

[0675]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
I-A-98	1.04	1.22	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.518(4.6);8.506(4.7);8.499(1.4);8.495(1.4); 8.487(1.3);8.483(1.4);8.402(1.7);8.396(1.9);7. 697(0.6);7.693(0.8);7.691(0.8);7.687(0.7);7.67 7(0.8);7.673(1.0);7.671(0.9);7.667(0.8);7.409(1.0);7.397(1.0);7.388(0.9);7.376(0.9);7.177(1. 3);7.165(2.5);7.152(1.2);6.433(1.8);3.950(1.1); 3.932(3.4);3.914(3.5);3.896(1.3);3.883(0.4);3. 874(0.4);3.868(0.5);3.860(0.5);3.853(0.4);3.84 4(0.4);3.771(15.0);2.527(0.7);2.164(4.4);1.958 (0.7);1.952(3.9);1.946(7.1);1.940(9.5);1.934(6. 7);1.928(3.5);1.197(3.7);1.179(7.4);1.161(3.6); 1.099(16.0);1.084(15.7);0.000(4.6)
I-A-99	0.66	0.87	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.553(1.9);8.543(6.2);8.531(5.7);7.924(0.9) ;7.904(1.1);7.575(0.9);7.563(1.0);7.555(1.0);7. 542(0.9);7.209(1.3);7.197(2.5);7.185(1.2);6.70 0(2.3);4.099(0.5);4.073(1.2);4.040(0.8);3.986(0.8);3.951(0.7);3.907(0.6);3.878(0.6);3.853(0. 5);3.810(15.8);3.760(0.4);3.654(1.0);3.467(16. 0);3.453(0.8);3.409(1.0);3.337(0.5);3.277(6.0); 1.964(0.6);1.958(1.5);1.952(8.2);1.946(15.0);1 .940(20.2);1.934(14.1);1.928(7.4);0.000(7.2)
I-A-100	1.58		¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 9.012(1.2);8.999(1.3);8.913(1.2);8.908(1.2) ;8.677(0.9);8.663(1.0);8.540(0.6);8.537(0.6);8. 516(0.7);8.078(0.7);8.063(0.7);8.057(0.7);8.04 3(0.8);7.953(2.1);7.724(1.5);7.711(1.5);7.549(0.9);3.995(9.5);3.554(9.5);2.970(0.3);2.919(16 .0);2.834(0.6);2.799(15.7);2.769(0.8);2.745(0. 9);2.623(1.5);2.607(3.8);2.593(6.2);2.578(3.9); 2.545(1.7);2.500(1.6);2.485(1.5);2.276(0.5);2. 201(0.4);2.120(0.3);2.114(0.4);2.108(0.5);2.10 1(0.4);1.965(1.2);1.958(2.8);1.953(16.1);1.947

[0676]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ; δ (ppm)
			(29.7);1.940(40.5);1.934(28.2);1.928(14.8);1.769(0.3);1.285(0.4);1.272(1.0);0.008(2.3);0.000(63.5);-0.008(3.0)
I-A-101	1.00		¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.471(1.0);8.461(1.1);8.428(1.4);8.423(1.4);8.342(1.1);8.329(1.2);8.032(0.8);7.719(0.7);7.716(0.9);7.713(0.8);7.709(0.7);7.699(0.9);7.695(1.0);7.693(0.9);7.689(0.8);7.398(0.9);7.385(0.9);7.377(0.9);7.365(0.8);7.040(1.7);7.027(1.6);6.458(1.3);3.780(16.0);3.428(16.0);2.380(12.8);2.153(65.7);2.119(0.5);2.113(0.5);2.107(0.5);2.100(0.4);1.963(1.9);1.957(4.5);1.952(24.5);1.945(44.5);1.939(59.8);1.933(40.8);1.927(20.7);1.768(0.3);0.146(0.7);0.008(6.5);0.000(147.6);-0.009(6.1);-0.150(0.7)
I-A-102	1.61	1.79	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.474(0.7);8.471(0.7);8.462(0.7);8.459(0.8);8.406(1.0);8.400(1.0);7.726(0.4);7.722(0.5);7.720(0.5);7.716(0.4);7.706(0.4);7.702(0.5);7.700(0.5);7.696(0.4);7.390(0.6);7.378(0.6);7.369(0.5);7.357(0.5);6.428(1.2);5.849(2.9);5.447(3.7);3.845(8.1);3.737(16.0);3.411(8.1);2.158(11.4);1.958(0.5);1.952(3.0);1.946(5.4);1.940(7.3);1.934(5.0);1.927(2.6);0.008(0.6);0.000(14.9);-0.008(0.6)
I-A-103	1.23		¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.474(1.1);8.463(1.1);8.428(1.3);8.174(1.9);7.717(0.8);7.714(0.9);7.708(0.7);7.697(0.9);7.693(1.0);7.691(1.0);7.687(0.8);7.398(1.0);7.387(1.0);7.378(0.9);7.366(0.8);6.449(1.0);4.089(0.5);3.915(0.4);3.774(15.5);3.451(0.5);3.427(16.0);2.467(0.4);2.340(12.4);2.179(265.0);2.159(12.3);2.113(0.4);2.107(0.4);2.101(0.3);1.964(2.2);1.952(27.8);1.946(50.3);1.940(67.5);1.934

[0677]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			(46.1);1.928(23.7);1.769(0.4);0.146(0.7);0.008(6.8);0.000(150.8);-0.008(6.8);-0.150(0.8)
I-A-104	0.97		¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.501(0.3);8.474(0.4);8.462(0.4);8.449(0.4);8.408(0.5);8.403(0.5);7.703(0.9);7.683(1.1);7.407(0.4);3.864(0.4);3.806(0.4);3.763(12.8);3.427(16.0);3.382(0.7);2.216(7.9);2.162(45.1);1.972(0.7);1.964(1.0);1.958(2.3);1.952(13.3);1.946(24.2);1.940(32.8);1.933(22.3);1.927(11.3);1.204(0.3);1.100(5.4);1.085(5.3);0.008(2.1);0.000(56.9);-0.009(2.0)
I-A-105	1.64	1.73	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 9.087(6.0);9.085(6.0);8.529(2.0);8.523(2.1);8.500(1.6);8.497(1.7);8.488(1.7);8.485(1.7);7.865(0.8);7.861(0.9);7.858(0.9);7.855(0.8);7.844(0.9);7.841(1.0);7.838(1.0);7.834(0.9);7.488(1.1);7.476(1.1);7.468(1.0);7.456(1.0);6.522(1.2);5.754(9.2);3.770(16.0);3.417(15.1);3.321(12.8);2.520(0.5);2.511(8.3);2.507(17.5);2.502(23.5);2.498(16.9);2.493(8.1);0.008(1.2);0.000(36.7);-0.009(1.2)
I-A-106	1.20		¹ H-NMR(601.6 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.512(1.5);8.508(1.6);8.490(1.2);8.483(1.2);8.337(3.1);8.328(3.1);7.881(0.8);7.879(1.0);7.877(0.9);7.875(0.8);7.868(0.9);7.865(1.1);7.864(1.0);7.861(0.9);7.466(1.0);7.458(1.0);7.453(1.0);7.445(0.9);6.726(3.3);6.716(3.3);6.467(1.1);3.900(2.4);3.791(15.7);3.697(16.0);3.401(14.9);3.358(1.0);3.328(672.2);3.304(2.7);3.282(0.5);3.174(1.0);3.165(1.0);2.617(0.6);2.614(0.8);2.611(0.5);2.523(1.4);2.520(1.8);2.517(2.0);2.508(46.4);2.505(93.3);2.502(127.2);2.499(96.7);2.496(49.0);2.389(0.6);2.386(0.8);2.383(0.6);1.909(0.5);0.000(0.9)

[0678]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
I-A-107	1.04	1.20	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.490(4.7);8.436(0.4);7.710(0.5);7.706(0.7) ;7.704(0.6);7.700(0.5);7.689(0.6);7.686(0.7);7. 683(0.7);7.680(0.6);7.406(0.4);7.394(0.5);7.38 6(0.5);7.374(0.4);6.491(0.6);5.446(3.5);3.776(15.9);3.430(16.0);1.958(0.5);1.952(3.8);1.946(7.1);1.939(9.8);1.933(6.7);1.927(3.4);1.538(0. 4);0.008(0.8);0.000(25.5);-0.009(0.9)
I-A-108	1.28	1.43	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.481(1.1);8.477(1.1);8.469(1.1);8.466(1.1) ;8.434(1.5);8.428(1.5);7.716(0.7);7.712(0.8);7. 709(0.8);7.706(0.7);7.695(0.8);7.692(0.9);7.68 9(0.9);7.685(0.8);7.509(1.1);7.490(2.1);7.470(1.2);7.396(0.9);7.394(0.9);7.384(1.0);7.382(0. 9);7.375(0.9);7.374(0.8);7.363(0.8);7.362(0.8); 7.005(1.6);6.986(1.4);6.564(1.5);6.544(1.4);6. 486(2.1);5.446(0.4);3.788(16.0);3.426(15.9);2. 401(10.8);2.152(13.0);1.964(0.5);1.957(1.0);1. 952(7.1);1.945(13.4);1.939(18.5);1.933(12.7); 1.927(6.5);1.270(0.4);0.008(1.3);0.000(40.6);- 0.009(1.7)
I-A-109			¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.483(0.7);8.473(0.7);8.429(0.8);8.202(0.6) ;7.705(0.6);7.701(0.7);7.698(0.7);7.694(0.6);7. 684(0.7);7.681(0.8);7.678(0.8);7.674(0.7);7.46 3(0.6);7.459(0.6);7.443(0.7);7.439(0.6);7.397(0.7);7.385(0.7);7.376(0.7);7.364(0.6);6.767(0. 7);6.747(0.7);6.482(0.5);5.447(1.3);3.767(15.6);3.421(16.0);2.249(7.3);2.158(11.1);1.958(0.6);1.952(4.5);1.945(8.5);1.939(11.8);1.933(8.0); 1.927(4.1);0.008(1.1);0.000(33.1);-0.009(1.1)
I-A-110	1.77	1.93	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.475(1.1);8.472(1.2);8.463(1.2);8.460(1.4) ;8.442(1.1);8.423(1.6);8.417(1.6);8.034(1.1);8.

[0679]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			015(1.1);7.718(0.7);7.714(0.8);7.711(0.8);7.708(0.7);7.697(0.8);7.693(1.0);7.691(1.0);7.687(0.8);7.402(1.0);7.390(1.1);7.381(1.0);7.369(0.9);7.327(0.8);7.315(0.8);7.307(0.8);7.295(0.7);6.490(1.8);5.447(3.1);3.763(0.6);3.756(0.6);3.734(16.0);3.429(15.9);3.388(1.1);2.190(31.2);1.958(0.5);1.952(3.9);1.946(7.3);1.940(10.1);1.934(6.8);1.928(3.5);0.007(0.6);0.000(17.0);-0.009(0.6)
I-A-111	1.73	1.78	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.609(14.5);8.597(14.9);8.564(0.6);8.552(0.6);8.447(3.8);8.442(4.5);8.436(4.2);8.432(4.3);8.314(0.5);8.082(0.6);7.914(5.5);7.866(0.3);7.420(1.4);7.414(1.1);7.404(3.8);7.399(6.5);7.394(7.9);7.382(4.8);7.363(4.0);7.346(8.0);7.328(7.5);7.313(6.9);7.301(8.8);7.293(4.8);7.290(5.3);7.276(1.3);7.219(0.4);7.201(0.6);7.184(0.5);7.158(8.1);7.140(7.1);7.078(0.3);6.637(3.6);5.685(0.5);5.597(0.5);5.485(16.0);3.392(0.8);3.375(0.8);3.357(0.5);3.319(142.2);3.287(36.5);3.266(0.7);3.212(0.4);2.671(1.1);2.506(140.0);2.502(186.0);2.498(152.0);2.329(1.1);1.355(0.4);1.109(0.7);1.091(1.5);1.074(0.7);0.146(0.8);0.000(164.9);-0.150(0.8)
I-A-112	0.56	0.85	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.740(5.4);8.728(5.6);8.485(3.5);8.480(3.7);8.472(1.7);8.469(1.7);7.842(0.8);7.838(0.9);7.835(0.9);7.831(0.9);7.821(0.9);7.817(1.1);7.815(1.1);7.811(0.9);7.458(1.2);7.446(1.2);7.438(1.1);7.425(1.1);7.410(1.4);7.398(2.6);7.385(1.3);6.224(3.6);4.469(9.4);4.098(0.6);4.085(0.6);3.642(16.0);3.357(15.2);3.321(16.5);3.176(2.7);3.163(2.7);2.525(0.4);2.511(10.4);2.507(21.6);2.502(29.1);2.498(21.8);2.493(11.3);0.008(0.5)

[0680]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
);0.000(16.5);-0.008(0.7)
I-A-113	0.66	0.93	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.919(0.4);8.693(0.3);8.551(2.4);8.547(2.3) ;8.526(3.7);8.516(3.3);8.510(2.5);8.496(2.9);8. 490(4.6);8.478(2.0);7.823(1.3);7.805(1.3);7.80 2(1.5);7.459(1.5);7.447(1.5);7.439(1.4);7.427(1.3);6.249(4.0);5.953(0.9);4.413(9.6);4.102(0. 5);4.089(0.5);3.603(16.0);3.355(15.6);3.327(2 1.3);3.175(2.5);3.163(2.4);2.784(0.9);2.771(0. 9);2.505(33.7);0.008(0.7);0.000(13.8)
I-A-114	0.20	0.85	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.497(3.9);8.492(3.3);8.485(2.0);8.482(1.8) ;7.815(0.8);7.809(1.0);7.805(0.9);7.795(1.0);7. 791(1.1);7.789(1.2);7.785(1.0);7.551(3.3);7.47 0(1.3);7.458(1.3);7.450(1.2);7.438(1.1);6.567(3.2);6.285(3.8);4.279(8.4);4.098(0.9);4.085(0. 9);3.560(16.0);3.540(15.9);3.360(15.8);3.342(0.6);3.321(9.3);3.303(0.6);3.175(4.2);3.163(4. 2);2.506(26.0);2.502(34.4);2.497(25.8);0.008(0.6);0.000(16.9);-0.008(0.7)
I-A-115	0.76	1.12	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.496(2.7);8.490(3.8);8.481(1.8);8.478(1.6) ;7.854(0.9);7.850(1.1);7.847(1.0);7.843(0.9);7. 833(1.0);7.829(1.2);7.827(1.1);7.823(0.9);7.55 7(2.6);7.552(2.5);7.468(1.3);7.456(1.3);7.448(1.2);7.436(1.2);6.278(3.8);5.939(2.8);5.934(2. 7);4.174(8.9);4.101(0.5);4.088(0.5);3.763(16.0);3.599(15.8);3.364(15.1);3.322(13.8);3.176(2. 2);3.162(2.1);2.524(0.5);2.506(20.9);2.502(26. 4);2.498(18.9);0.008(0.4);0.000(11.8);-0.009(0 .4)
I-A-116	0.16	1.11	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.500(1.6);8.497(1.8);8.488(1.8);8.485(1.8) ;8.472(2.6);8.464(4.8);8.460(2.9);8.448(4.3);8.

[0681]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			439(0.5);8.435(0.5);7.843(0.8);7.837(1.1);7.833(0.9);7.823(1.0);7.817(1.2);7.813(1.0);7.467(1.3);7.455(1.3);7.447(1.3);7.435(1.2);7.237(0.4);7.222(0.4);7.194(3.6);7.179(3.6);6.269(3.8);4.246(8.1);3.681(0.4);3.600(0.4);3.580(16.0);3.385(0.5);3.353(15.5);3.321(33.9);2.506(38.1);2.502(50.4);2.498(38.7);2.329(0.3);1.236(0.4);0.007(1.0);0.000(25.1)
I-A-117	0.63	1.16	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.495(1.8);8.492(2.7);8.484(2.7);8.477(4.1);8.472(3.1);7.846(0.8);7.843(1.0);7.840(1.0);7.836(0.9);7.826(0.9);7.822(1.1);7.820(1.1);7.816(0.9);7.728(0.8);7.723(0.8);7.708(1.6);7.704(1.6);7.689(0.9);7.685(0.9);7.561(0.6);7.467(1.3);7.456(1.3);7.447(1.2);7.435(1.1);7.282(1.1);7.270(1.2);7.266(1.1);7.251(1.0);7.231(1.9);7.211(1.7);6.257(3.8);4.416(1.1);4.345(9.1);4.249(0.3);3.644(1.8);3.638(0.7);3.580(16.0);3.383(0.6);3.356(15.4);3.319(53.6);2.708(0.8);2.697(0.8);2.671(0.5);2.666(0.4);2.506(62.1);2.502(81.5);2.497(61.2);2.333(0.4);2.328(0.5);2.324(0.4);1.236(0.8);0.008(1.3);0.000(34.7);-0.008(1.6)
I-A-118		0.89	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.495(2.2);8.489(3.7);8.480(1.6);8.476(1.7);7.839(0.8);7.835(0.9);7.832(1.0);7.829(0.9);7.818(0.9);7.815(1.0);7.812(1.1);7.808(0.9);7.464(1.1);7.452(1.1);7.444(1.0);7.432(1.0);7.074(2.9);7.072(3.2);6.787(2.9);6.784(3.1);6.283(3.5);4.307(9.3);3.574(15.6);3.480(16.0);3.362(14.8);3.315(3.7);3.173(1.1);3.163(1.1);2.524(0.7);2.511(15.9);2.506(33.8);2.502(46.0);2.497(34.9);2.493(18.1);0.008(0.7);0.000(22.2);-0.008(1.0)

[0682]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
I-A-119	0.39	1.15	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.500(1.5);8.496(1.8);8.491(2.5);8.485(3.8) ;8.444(1.3);8.440(1.4);8.432(1.4);8.428(1.5);8. 413(1.9);8.408(2.0);7.831(0.8);7.827(1.0);7.82 5(0.9);7.821(0.8);7.811(0.9);7.807(1.0);7.804(1.0);7.801(0.9);7.596(0.7);7.592(1.1);7.587(0. 7);7.577(0.8);7.572(1.2);7.567(0.8);7.470(1.2); 7.457(1.2);7.450(1.1);7.437(1.1);7.314(1.1);7. 303(1.1);7.295(1.0);7.283(0.9);6.281(3.7);4.26 9(7.6);3.553(16.0);3.355(15.2);3.317(44.0);2.6 77(0.5);2.672(0.6);2.668(0.5);2.525(1.8);2.512 (38.7);2.508(79.5);2.503(106.6);2.499(79.6);2. 334(0.5);2.330(0.7);2.325(0.5);0.008(0.7);0.00 0(22.6);-0.008(1.0)
I-A-120	1.34	1.55	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.491(1.9);8.479(1.9);8.468(2.6);8.461(2.7) ;8.132(0.7);7.830(1.2);7.826(1.1);7.809(1.4);7. 805(1.1);7.574(2.7);7.571(2.9);7.569(2.9);7.46 7(1.4);7.455(1.4);7.446(1.4);7.435(1.3);6.361(1.5);6.354(2.1);6.349(1.8);6.297(4.1);6.060(2. 3);6.052(2.3);5.751(2.0);4.269(9.4);3.570(16.0);3.360(15.6);3.310(7.8);2.501(26.9);2.497(21. 9);-0.001(1.7)
I-A-121	2.51	2.62	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.496(1.6);8.492(1.7);8.484(3.9);8.480(3.3) ;8.136(0.8);7.842(0.8);7.838(1.0);7.836(1.0);7. 832(0.9);7.822(0.9);7.818(1.1);7.816(1.1);7.81 2(0.9);7.553(2.6);7.548(2.7);7.536(2.7);7.516(2.9);7.460(1.2);7.448(1.2);7.440(1.2);7.428(1. 1);7.178(1.5);7.173(1.5);7.157(1.3);7.152(1.3); 6.280(3.8);5.751(2.6);4.258(7.7);3.600(16.0);3 .358(15.4);3.310(8.4);2.524(0.6);2.506(30.2);2 .501(39.9);2.497(29.9);0.000(3.0)
I-A-122	1.37	1.58	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ

[0683]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			= 8.481(1.7);8.472(1.9);8.469(1.8);8.394(2.3);8.388(2.6);8.172(2.0);8.166(2.3);7.654(1.2);7.651(1.1);7.640(1.1);7.634(1.4);7.630(1.2);7.577(1.2);7.570(1.4);7.556(1.4);7.550(1.5);7.394(1.3);7.382(1.5);7.374(1.4);7.362(1.2);7.310(2.3);7.290(2.0);6.268(3.7);4.186(8.5);3.701(0.4);3.584(15.6);3.370(16.0);2.501(1.2);2.163(40.1);2.113(0.5);2.106(0.4);2.100(0.4);1.951(13.0);1.945(23.4);1.939(32.0);1.933(25.9);1.927(16.2);1.270(0.4);0.000(24.1);-0.008(5.9)
I-A-123	1.69	1.92	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.487(1.3);8.484(1.3);8.475(1.3);8.472(1.3);8.391(1.7);8.386(1.7);7.675(0.7);7.671(0.8);7.668(0.8);7.664(0.7);7.654(0.9);7.650(1.0);7.648(0.9);7.644(0.8);7.395(1.0);7.393(1.0);7.383(1.0);7.381(1.0);7.375(0.9);7.373(0.9);7.363(0.9);7.361(0.8);7.331(0.6);7.327(0.6);7.314(0.4);7.310(1.2);7.306(0.4);7.293(0.6);7.289(0.7);7.272(0.3);6.956(1.6);6.936(2.6);6.927(0.3);6.916(1.5);6.264(3.2);5.447(2.6);4.156(5.1);3.628(15.2);3.376(16.0);2.178(21.3);1.958(0.5);1.952(3.5);1.946(6.5);1.940(8.9);1.934(6.1);1.927(3.1);0.008(0.6);0.000(16.4);-0.009(0.6)
I-A-124	1.72	2.03	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.479(1.3);8.476(1.3);8.467(1.3);8.464(1.2);8.406(1.5);8.404(1.6);8.399(1.5);8.398(1.4);7.682(0.8);7.678(0.9);7.675(0.8);7.671(0.8);7.661(1.0);7.658(1.0);7.655(0.9);7.651(0.8);7.391(1.0);7.389(1.0);7.379(1.0);7.377(1.0);7.371(0.9);7.369(0.9);7.359(0.8);7.357(0.8);7.286(0.5);7.269(0.7);7.265(1.2);7.248(1.2);7.244(0.7);7.227(0.6);6.770(1.3);6.749(1.1);6.712(0.7);6.689(1.3);6.668(0.6);6.666(0.6);6.268(3.0);5.451(0.4);5.447(5.1);4.150(4.4);4.147(4.2);3.754(14

[0684]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			.4);3.619(15.8);3.379(16.0);2.170(42.1);1.964(0.4);1.958(0.9);1.952(4.1);1.946(7.2);1.940(9.5);1.933(6.4);1.927(3.2);0.008(1.0);0.004(1.6);0.000(15.8);-0.009(0.6)
I-A-125	2.09	2.28	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.484(1.2);8.481(1.3);8.472(1.3);8.469(1.3);8.428(1.6);8.422(1.7);7.696(0.7);7.693(0.8);7.690(0.7);7.686(0.7);7.676(0.8);7.672(0.9);7.670(0.9);7.666(0.8);7.396(1.0);7.394(0.9);7.384(1.0);7.382(0.9);7.375(1.1);7.3704(2.7);7.3698(2.7);7.364(1.0);7.350(4.5);7.259(1.7);7.240(1.4);7.237(1.2);7.219(0.9);6.271(3.1);5.448(5.4);4.362(8.2);3.754(0.3);3.633(16.0);3.382(16.0);2.181(32.5);1.964(0.3);1.958(0.7);1.952(5.1);1.946(9.5);1.940(13.1);1.934(8.9);1.928(4.6);0.008(0.7);0.000(22.2);-0.009(0.7)
I-A-126	2.47	2.54	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.485(1.2);8.482(1.3);8.474(1.2);8.470(1.3);8.430(1.6);8.424(1.6);7.709(1.1);7.690(2.8);7.688(2.7);7.670(2.0);7.664(0.8);7.481(0.7);7.461(1.2);7.441(0.5);7.393(0.9);7.391(0.9);7.381(0.9);7.380(0.9);7.373(0.8);7.371(0.8);7.361(0.8);7.359(0.8);6.295(3.3);5.446(5.7);4.461(4.7);3.756(0.6);3.659(16.0);3.388(15.9);3.274(0.6);2.141(8.8);1.958(0.7);1.952(5.1);1.946(9.5);1.939(13.1);1.933(8.9);1.927(4.5);0.008(0.8);0.000(24.1);-0.009(0.7)
I-A-127	1.89	2.09	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.487(1.4);8.483(1.5);8.475(1.4);8.472(1.5);8.404(2.0);8.397(2.0);7.685(0.8);7.681(0.9);7.679(1.0);7.675(0.9);7.665(0.9);7.661(1.0);7.658(1.1);7.655(0.9);7.395(1.2);7.383(1.2);7.375(1.1);7.363(1.0);7.314(0.5);7.299(0.5);7.293(1.2);7.279(1.2);7.273(1.1);7.259(1.2);7.245(2.1);

[0685]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			7.226(0.8);7.072(0.9);7.052(1.4);7.032(0.6);7.028(0.6);6.267(3.5);5.448(6.5);4.238(5.1);4.235(5.2);3.625(16.0);3.378(16.0);2.189(25.7);1.953(3.9);1.947(6.8);1.940(9.0);1.934(6.1);1.928(3.1);0.008(0.8);0.000(13.5);-0.009(0.5)
I-A-128	1.41	1.68	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.465(0.6);8.461(0.6);8.453(0.6);8.449(0.6);8.402(0.8);8.396(0.8);7.676(0.4);7.673(0.4);7.670(0.4);7.666(0.4);7.656(0.4);7.652(0.4);7.650(0.4);7.646(0.4);7.374(0.5);7.372(0.5);7.362(0.5);7.360(0.5);7.354(0.4);7.352(0.4);7.342(0.4);7.340(0.4);6.257(1.7);5.958(2.3);5.447(0.5);4.217(4.4);3.813(16.0);3.696(8.0);3.689(0.4);3.375(8.0);2.169(14.8);1.958(0.4);1.952(2.7);1.946(5.0);1.940(6.9);1.934(4.7);1.928(2.4);0.000(9.7);-0.009(0.4)
I-A-129	2.32	2.44	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.488(1.2);8.484(1.3);8.476(1.3);8.472(1.3);8.411(1.6);8.405(1.7);7.696(0.7);7.692(0.8);7.689(0.8);7.686(0.7);7.675(0.8);7.672(0.9);7.669(0.9);7.665(0.7);7.402(1.0);7.400(0.9);7.390(1.0);7.388(0.9);7.381(0.9);7.380(0.8);7.370(0.8);7.368(0.8);7.100(0.5);7.084(0.9);7.078(1.0);7.063(1.8);7.031(3.3);7.012(1.2);6.306(3.5);5.446(6.4);4.259(7.8);3.764(0.6);3.552(16.0);3.376(15.8);3.268(0.6);2.416(0.3);2.340(0.3);2.328(0.4);2.255(20.5);2.169(23.9);1.972(0.7);1.963(0.3);1.957(0.7);1.952(4.9);1.945(9.1);1.939(12.6);1.933(8.6);1.927(4.4);0.008(0.5);0.000(16.5);-0.009(0.6)
I-A-130	1.18		¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.514(1.8);8.511(1.7);8.503(1.9);8.384(2.5);8.378(2.2);7.715(1.1);7.711(1.2);7.695(1.3);7.691(1.4);7.427(1.2);7.414(1.4);7.406(1.2);7.39

[0686]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ; δ (ppm)
			5(1.1);7.362(5.2);7.356(5.1);7.351(3.6);7.349(3.7);7.056(2.4);7.051(2.5);7.041(2.6);6.448(2.3);4.422(8.2);3.544(16.0);3.387(16.0);2.134(175.3);2.125(19.2);2.106(1.4);2.100(0.9);1.951(85.8);1.945(141.2);1.939(167.4);1.933(116.4);1.927(58.6);1.773(0.8);1.767(0.9);1.761(0.7);1.286(0.4);1.273(0.5);0.146(0.4);0.080(0.8);0.000(68.9);-0.009(7.5);-0.149(0.4);-0.383(6.2)
I-A-131	1.28	1.40	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.501(2.5);8.494(2.8);8.488(1.9);8.480(1.7);8.476(1.8);7.831(0.8);7.827(1.0);7.825(1.0);7.821(0.9);7.810(0.9);7.804(1.2);7.800(1.0);7.455(1.4);7.443(1.4);7.434(1.3);7.422(1.2);6.819(3.8);6.355(3.1);5.667(8.2);4.109(0.6);4.096(1.7);4.083(1.7);4.070(0.6);3.544(16.0);3.361(15.8);3.321(18.5);3.176(8.0);3.163(7.7);2.525(0.5);2.507(20.5);2.502(27.6);2.498(20.8);2.003(12.4);0.008(0.5);0.000(14.7);-0.008(0.7)
I-A-132	0.59	0.94	¹ H-NMR(601.6 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.504(2.0);8.500(2.0);8.480(1.5);8.478(1.5);8.473(1.6);8.470(1.5);8.165(0.8);8.160(0.8);7.842(0.9);7.839(1.0);7.838(1.0);7.835(0.9);7.828(1.0);7.826(1.1);7.824(1.1);7.822(0.9);7.449(1.1);7.448(1.1);7.441(1.1);7.440(1.1);7.436(1.1);7.435(1.0);7.428(1.0);7.427(1.0);6.218(2.3);3.710(0.6);3.699(16.0);3.694(9.2);3.361(14.9);3.315(18.1);3.173(0.5);3.164(0.5);2.578(0.4);2.572(0.6);2.566(0.9);2.560(0.9);2.554(0.6);2.548(0.4);2.507(6.8);2.504(14.0);2.501(18.8);2.498(13.9);2.495(6.6);0.596(0.6);0.587(1.8);0.584(2.3);0.576(2.3);0.572(1.9);0.564(0.7);0.337(0.7);0.329(2.0);0.325(2.1);0.322(1.9);0.319(2.0);0.311(0.6);0.000(0.5)
I-A-133	1.06	1.22	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ

[0687]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			= 8.464(0.9);8.425(0.4);7.897(0.4);7.719(0.6);7.701(0.9);7.385(0.6);6.340(1.0);6.245(0.7);3.982(0.4);3.843(2.2);3.739(10.6);3.640(4.0);3.625(4.7);3.610(0.7);3.567(9.3);3.389(8.2);3.380(4.0);2.308(16.0);1.964(1.1);1.952(13.8);1.946(25.4);1.940(34.5);1.933(24.6);1.927(13.0);1.849(0.5);1.832(0.4);1.774(0.5);1.768(0.5);1.762(0.5);1.756(0.5);1.305(15.6);0.146(0.3);0.008(3.6);0.000(78.1);-0.150(0.4)
I-A-134	1.27	1.56	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.438(1.2);8.434(1.2);8.426(1.3);8.422(1.5);8.419(1.7);8.412(1.6);7.685(0.7);7.681(0.8);7.679(0.8);7.675(0.7);7.665(0.8);7.661(0.9);7.658(0.9);7.654(0.8);7.559(1.2);7.539(1.3);7.434(1.0);7.414(1.4);7.357(0.9);7.356(0.9);7.345(0.9);7.344(0.9);7.337(0.9);7.335(0.8);7.325(0.8);7.324(0.8);7.307(0.6);7.305(0.7);7.289(1.2);7.287(1.3);7.269(0.9);7.266(0.8);7.243(1.0);7.240(1.0);7.222(1.2);7.220(1.0);7.205(0.5);7.202(0.5);6.392(1.8);5.447(3.0);3.855(15.7);3.764(16.0);3.404(15.8);3.388(0.4);2.184(70.5);1.972(0.9);1.964(0.6);1.958(1.2);1.952(7.8);1.946(14.5);1.940(19.8);1.934(13.5);1.927(6.9);1.269(0.5);1.204(0.5);0.008(0.5);0.000(16.6);-0.009(0.6)
I-A-135	0.62	0.89	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.470(0.5);8.407(0.5);7.699(0.6);7.696(0.7);7.693(0.7);7.690(0.6);7.679(0.7);7.675(0.8);7.673(0.8);7.669(0.7);7.386(0.6);7.374(0.6);7.366(0.5);7.354(0.5);6.435(1.1);5.447(1.5);3.880(15.2);3.847(0.7);3.411(15.1);2.649(0.7);2.436(16.0);2.163(23.5);1.964(0.4);1.958(0.7);1.952(4.6);1.946(8.5);1.940(11.8);1.934(8.1);1.928(4.1);0.008(0.5);0.000(13.5);-0.009(0.5)

[0688]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ; δ (ppm)
I-A-136			¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.637(1.7);8.635(1.6);8.473(0.8);8.463(0.8);8.440(0.9);8.158(1.4);7.718(0.6);7.714(0.7);7.711(0.7);7.708(0.6);7.697(0.7);7.694(0.9);7.691(0.9);7.687(0.8);7.395(0.7);7.383(0.8);7.374(0.8);7.363(0.7);6.481(0.5);6.222(0.5);5.447(5.0);3.849(15.1);3.808(14.9);3.763(3.8);3.427(16.0);3.388(3.9);2.171(32.3);1.965(0.5);1.959(1.0);1.953(6.7);1.947(12.4);1.940(17.2);1.934(11.7);1.928(5.9);0.008(0.6);0.000(18.6);-0.009(0.6)
I-A-137	1.41	1.46	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.453(0.6);8.442(0.7);8.396(0.8);7.673(0.7);7.670(0.8);7.667(0.7);7.663(0.6);7.653(0.7);7.649(0.8);7.647(0.8);7.643(0.7);7.356(0.8);7.345(0.7);7.336(0.7);7.324(0.6);6.357(1.3);5.446(4.8);4.263(0.7);4.245(2.2);4.227(2.2);4.208(0.7);3.926(16.0);3.756(1.9);3.393(15.7);3.388(2.5);2.142(12.3);1.963(0.5);1.957(1.0);1.952(5.6);1.945(10.4);1.939(14.4);1.933(9.9);1.927(5.0);1.295(2.7);1.277(5.6);1.259(2.7);0.000(0.6)
I-A-138	1.12	1.26	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.455(0.9);8.444(0.9);8.395(1.1);7.676(0.7);7.672(0.9);7.670(0.9);7.666(0.7);7.656(0.8);7.652(1.0);7.650(1.0);7.646(0.8);7.362(0.9);7.350(1.0);7.341(0.9);7.330(0.8);6.339(1.8);5.446(3.6);3.902(16.0);3.733(10.1);3.390(16.0);3.021(0.3);2.141(17.9);1.963(0.5);1.957(1.0);1.951(5.7);1.945(10.6);1.939(14.5);1.933(10.1);1.927(5.1);0.000(0.5)
I-A-139	0.87	1.00	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.452(1.2);8.441(1.2);8.395(1.6);8.390(1.5);7.673(0.8);7.668(1.0);7.664(0.8);7.652(0.9);7.647(1.2);7.643(0.9);7.359(1.1);7.347(1.1);7.33

[0689]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ; δ (ppm)
			9(1.0);7.327(1.0);7.103(1.3);6.973(2.7);6.843(1.3);6.321(2.2);5.447(4.0);4.103(0.7);3.923(0.7);3.894(16.0);3.718(13.2);3.388(15.8);3.021(1.7);2.162(23.5);1.964(0.7);1.958(1.7);1.952(8.0);1.946(14.1);1.940(18.8);1.934(12.8);1.928(6.4);1.271(0.4);0.882(0.6)
I-A-140	1.92	1.96	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.482(0.9);8.473(0.9);8.470(0.9);8.411(1.1);8.406(1.0);7.931(0.4);7.924(2.0);7.920(2.1);7.916(1.0);7.915(1.0);7.910(0.9);7.904(2.0);7.900(2.2);7.727(0.8);7.723(0.9);7.720(0.8);7.716(0.8);7.706(0.9);7.703(0.9);7.700(0.9);7.696(0.8);7.572(0.4);7.568(0.3);7.554(0.9);7.552(1.0);7.545(0.8);7.541(1.6);7.536(2.9);7.535(2.8);7.530(1.6);7.524(0.9);7.520(1.3);7.516(2.2);7.509(0.4);7.505(0.5);7.501(0.7);7.494(0.5);7.394(0.8);7.392(0.9);7.382(0.9);7.380(0.9);7.372(0.8);7.361(0.7);7.360(0.7);6.530(1.6);5.447(2.7);3.886(16.0);3.870(0.7);3.425(15.8);3.410(0.7);2.156(9.3);1.964(1.3);1.958(1.9);1.952(7.0);1.946(11.8);1.940(15.9);1.934(11.1);1.927(6.1);0.000(2.5)
I-A-141	1.39	1.84	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.438(1.4);8.390(1.2);7.687(0.4);7.666(1.4);7.646(1.3);7.489(2.5);7.472(2.0);7.393(3.4);7.353(1.3);7.344(1.4);5.446(5.4);4.057(0.4);3.861(2.4);3.805(2.7);3.763(0.5);3.602(2.4);3.433(0.5);3.387(16.0);2.156(30.0);1.963(0.8);1.951(8.5);1.945(15.3);1.939(20.4);1.933(14.6);1.927(7.7);1.269(0.7);0.823(0.3);0.000(1.9)
I-A-142	1.31	1.47	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.464(1.0);8.454(1.0);8.405(1.3);8.399(1.2);7.688(0.8);7.684(0.9);7.682(0.9);7.678(0.8);7.668(0.8);7.664(0.9);7.662(0.9);7.658(0.8);7.37

[0690]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			5(1.0);7.363(1.0);7.355(0.9);7.343(0.8);6.391(1.3);5.447(6.3);3.845(16.0);3.763(0.3);3.405(16.0);3.388(0.5);2.174(22.0);1.983(7.9);1.982(8.1);1.964(0.7);1.958(1.1);1.952(4.0);1.946(6.8);1.940(9.0);1.934(6.0);1.928(3.0);1.270(0.4);0.000(0.5)
I-A-143	1.12	1.27	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.450(1.0);8.447(1.0);8.438(1.0);8.435(1.0);8.392(1.3);8.386(1.3);7.666(0.7);7.662(0.8);7.660(0.8);7.656(0.6);7.646(0.8);7.642(0.9);7.639(0.9);7.636(0.7);7.611(0.7);7.358(0.9);7.347(0.9);7.338(0.8);7.326(0.7);6.325(0.5);5.447(5.2);3.863(10.4);3.830(8.8);3.810(0.5);3.799(16.0);3.763(0.8);3.386(15.7);2.164(26.8);1.964(0.6);1.958(1.2);1.952(6.7);1.946(12.4);1.940(17.0);1.934(11.6);1.928(5.8);1.270(0.4);0.000(1.5)
I-A-144		0.86	¹ H-NMR(400.0 MHz. CD ₃ CN): δ = 8.447(1.4);8.443(1.5);8.435(1.4);8.432(1.5);8.386(2.0);8.379(2.0);7.659(0.7);7.655(0.9);7.650(0.8);7.639(0.8);7.634(1.0);7.630(0.8);7.351(1.1);7.339(1.1);7.331(1.0);7.319(1.0);7.129(2.9);6.962(2.8);6.259(2.8);5.447(4.1);3.853(16.0);3.806(1.4);3.647(15.2);3.386(1.9);3.375(15.7);2.170(4.9);1.964(0.5);1.958(1.0);1.952(4.8);1.946(8.7);1.939(11.8);1.933(8.3);1.927(4.3);0.000(1.0)
I-A-145	0.31	0.85	¹ H-NMR(600.1 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.587(5.5);8.585(5.8);8.580(6.0);8.577(6.0);8.571(7.7);8.568(7.8);7.894(3.4);7.891(4.0);7.890(3.9);7.887(3.5);7.880(3.8);7.878(4.2);7.876(4.3);7.874(3.7);7.5254(4.5);7.5245(4.4);7.5174(4.5);7.5166(4.4);7.512(4.4);7.511(4.4);7.504(4.2);7.503(4.1);5.718(5.0);4.449(8.6);4.437(

	实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
				15.3);4.424(9.6);3.948(10.1);3.935(16.0);3.923(9.0);3.790(0.4);3.686(0.5);3.494(0.5);3.459(0.6);3.450(0.7);3.370(4.4);3.346(7.9);3.335(73.5);3.216(0.6);2.794(0.4);2.787(0.4);2.720(2.5);2.614(0.5);2.611(0.3);2.523(0.7);2.520(0.9);2.517(0.8);2.508(23.1);2.505(50.2);2.502(69.7);2.499(51.5);2.496(25.3);2.389(0.3);2.386(0.5);2.383(0.3);1.194(0.4);1.182(0.7);1.170(0.4);0.000(2.5)
[0691]	I-A-146	1.11	1.27	¹ H-NMR(400.0 MHz. d ₆ -DMSO): δ = 8.632(15.5);8.620(16.0);8.505(3.7);8.502(4.1);8.493(4.1);8.490(4.6);8.485(5.6);8.479(5.4);8.313(0.5);7.842(1.9);7.838(2.3);7.835(2.3);7.831(2.1);7.821(2.2);7.817(2.5);7.815(2.7);7.811(2.2);7.492(2.9);7.480(2.9);7.471(2.7);7.459(2.6);7.329(4.1);7.317(7.8);7.304(4.0);6.535(4.3);5.754(1.0);4.306(1.7);4.288(5.9);4.271(6.0);4.253(1.8);3.417(36.1);3.317(141.0);2.675(1.1);2.670(1.4);2.666(1.0);2.524(3.5);2.510(74.8);2.506(159.0);2.501(224.8);2.497(171.3);2.492(84.5);2.333(0.9);2.328(1.3);2.324(1.0);1.310(6.5);1.292(14.9);1.274(6.4);0.146(0.6);0.008(4.5);0.000(133.6);-0.008(5.1);-0.150(0.6)

[0692] 生物实施例

[0693] 根结线虫 (*Meloidogyne incognita*) 测试

[0694] 溶剂:125.0重量份的丙酮

[0695] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物与所述量的溶剂混合,并将浓缩物用水稀释至所需浓度。

[0696] 向容器内装入沙子、活性化合物溶液、南方根结线虫(根结线虫(*Meloidogyne incognita*))的卵/幼虫悬浮液和莴笋种子。莴笋种子发芽,并长成植物。虫瘿在根部生长。

[0697] 14天后,通过形成的虫瘿测定以%计的杀线虫功效。100%意指未发现虫瘿;0%意指经处理的植物上的虫瘿数量与未处理的对照组相当。

[0698] 在本测试中,例如,以下制备实施例的化合物在施用率为20ppm下显示出90%的功效:I-A-7;I-A-35。

[0699] 桃蚜 (*Myzus persicae*) - 喷雾测试

[0700] 溶剂: 78重量份的丙酮

[0701] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0702] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0703] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物用所述重量份的溶剂溶解,并用含有乳化剂浓度为1000ppm的水补充直到获得所需的浓度。为了制备其他测试浓度,将该制剂用含乳化剂的水稀释。

[0704] 向被所有阶段的绿桃蚜(桃蚜(*Myzus persicae*))侵染的大白菜(白菜(*Brassica pekinensis*))叶片的叶面上喷洒所需浓度的活性化合物制剂。

[0705] 5或6天后,测定以%计的功效。100%意指所有蚜虫都已被杀死;0%意指没有蚜虫被杀死。

[0706] 在本测试中,例如,以下制备实施例的化合物在施用率为500g/ha下显示出100%的功效:I-A-1、I-A-2、I-A-3、I-A-8、I-A-10、I-A-11、I-A-18、I-A-19、I-A-21、I-A-22、I-A-26、I-A-37、I-A-40、I-A-45、I-A-46、I-A-47、I-A-48、I-A-49、I-A-50、I-A-51、I-A-52、I-A-53、I-A-54、I-A-65、I-A-68、I-A-69、I-A-70、I-A-71、I-A-94、I-A-95、I-A-96、I-A-101、I-A-102、I-A-103、I-A-104、I-A-105、I-A-106、I-A-108、I-A-110、I-A-112、I-A-116、I-A-122、I-A-126、I-A-134、I-A-135、I-A-136、I-A-138、I-A-139、I-A-140、I-A-141、I-A-144、I-A-145、I-B-1。

[0707] 在本测试中,例如,以下制备实施例的化合物在施用率为500g/ha下显示出90%的功效:I-A-5、I-A-6、I-A-7、I-A-12、I-A-14、I-A-16、I-A-23、I-A-24、I-A-25、I-A-27、I-A-28、I-A-30、I-A-31、I-A-36、I-A-38、I-A-39、I-A-41、I-A-55、I-A-58、I-A-59、I-A-60、I-A-61、I-A-62、I-A-64、I-A-67、I-A-73、I-A-74、I-A-75、I-A-77、I-A-79、I-A-82、I-A-83、I-A-84、I-A-86、I-A-87、I-A-97、I-A-98、I-A-100、I-A-107、I-A-109、I-A-113、I-A-117、I-A-119、I-A-120、I-A-123、I-A-124、I-A-125、I-A-127、I-A-128、I-A-130、I-A-131、I-A-132、I-A-137、I-A-142。

[0708] 在本测试中,例如,以下制备实施例的化合物在施用率为100g/ha下显示出90%的功效:I-A-78、I-A-146。

[0709] 在本测试中,例如,以下制备实施例的化合物在施用率为20g/ha下显示出90%的功效:I-A-9。

[0710] 二斑叶螨(*Tetranychus urticae*)-喷雾测试,0P-抗性

[0711] 溶剂: 78.0重量份的丙酮

[0712] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0713] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0714] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物用所述重量份的溶剂溶解,并用含有乳化剂浓度为1000ppm的水补充直到获得所需的浓度。为了制备其他测试浓度,将该制剂用含有乳化剂的水稀释。

[0715] 向被所有阶段的温室红蜘蛛螨(二斑叶螨(*Tetranychus urticae*))侵染的菜豆(*Phaseolus vulgaris*)叶的叶面上喷洒所需浓度的活性化合物制剂。

[0716] 6天后,测定以%计的功效。100%意指所有蜘蛛螨都已被杀死;0%意指没有蜘蛛螨被杀死。

[0717] 在本测试中,例如,以下制备实施例的化合物在施用率为500g/ha下显示出90%的功效:I-A-6、I-A-78、I-A-105。

[0718] 辣根猿叶虫 (Phaedon cochleariae) -喷雾测试

[0719] 溶剂: 78.0重量份的丙酮

[0720] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0721] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0722] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物用所述重量份的溶剂溶解,并用含有乳化剂浓度为1000ppm的水补充直到获得所需的浓度。为了制备其他测试浓度,将该制剂用含有乳化剂的水稀释。

[0723] 向大白菜(白菜(*Brassica pekinensis*))叶的叶面上喷洒所需浓度的活性化合物制剂,并在干燥后,接种芥菜甲虫(辣根猿叶甲)的幼虫。

[0724] 7天后,测定以%计的功效。100%意指所有甲虫幼虫都已被杀死;0%意指没有甲虫幼虫被杀死。

[0725] 在本测试中,例如,以下制备实施例的化合物在施用率为500g/h下显示出100%的功效:I-A-79、I-A-80。

[0726] 在本测试中,例如,以下制备实施例的化合物在施用率为500g/h下显示出83%的功效:I-A-15。

[0727] 桃蚜 (Myzus persicae) -喷雾测试

[0728] 溶剂:14重量份的二甲基甲酰胺

[0729] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0730] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物用所述重量份的溶剂溶解,并用含有乳化剂浓度为1000ppm的水补充直到获得所需的浓度。为了制备其他测试浓度,将制剂用含有乳化剂的水稀释。如果需要加入铵盐或/和渗透剂,则将它们各自以1000ppm的浓度加入制剂溶液中。

[0731] 通过喷洒所需浓度的活性化合物制剂来处理被绿桃蚜(桃蚜)严重侵染的柿子椒植物(甜椒(*Capsicum annuum*))。

[0732] 6天后,测定以%计的杀死率。100%意指所有蚜虫都已被杀死;0%意指没有蚜虫被杀死。

[0733] 在本测试中,例如,以下制备实施例的化合物在施用率为100ppm下显示出99%的功效:I-A-66。

[0734] 在本测试中,例如,以下制备实施例的化合物在施用率为20ppm下显示出100%的功效:I-A-44、I-A-99。

[0735] 在本测试中,例如,以下制备实施例的化合物在施用率为20ppm下显示出99%的功效:I-A-4、I-A-20、I-A-57、I-A-89。

[0736] 在本测试中,例如,以下制备实施例的化合物在施用率为20ppm下显示出95%的功效:I-A-93。

[0737] 对比实施例

[0738] 桃蚜 (Myzus persicae) -喷雾测试 (MYZUPE)

[0739] 溶剂: 78.0重量份的丙酮

[0740] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0741] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0742] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物用所述重量份的溶剂溶解,并用含有乳化剂浓度为1000ppm的水补充直到获得所需的浓度。为了制备其他测试浓度,将该制剂用含有乳化剂的水稀释。

[0743] 向被所有阶段的绿桃蚜(桃蚜(*Myzus persicae*))侵染的大白菜(白菜(*Brassica pekinensis*))叶的叶面上喷洒所需浓度的活性化合物制剂。

[0744] 在所需时间后,测定以%计的功效。100%意指所有蚜虫都已被杀死;0%意指没有蚜虫被杀死。

[0745] 在本测试中,与现有技术相比,例如以下制备实施例的化合物显示出优异的功效:见表。

[0746] 二斑叶螨(*Tetranychus urticae*)-喷雾测试,OP-抗性(TETRUR)

[0747] 溶剂: 78.0重量份的丙酮

[0748] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0749] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0750] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物用所述重量份的溶剂溶解,并用含有乳化剂浓度为1000ppm的水补充直到获得所需的浓度。为了制备其他测试浓度,将该制剂用含有乳化剂的水稀释。

[0751] 向被所有阶段的温室红蜘蛛螨(二斑叶螨(*Tetranychus urticae*))侵染的菜豆(*Phaseolus vulgaris*)叶的叶面上喷洒所需浓度的活性化合物制剂。

[0752] 在所需时间后,测定以%计的功效。100%意指所有蜘蛛螨都被杀死;0%意指没有蜘蛛螨被杀死。

[0753] 在本测试中,与现有技术相比,例如以下制备实施例的化合物显示出优异的功效:见表。

[0754] 辣根猿叶虫(*Phaedon cochleariae*)-喷雾测试(PHAECO)

[0755] 溶剂: 78.0重量份的丙酮

[0756] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0757] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

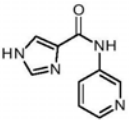
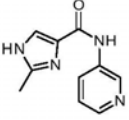
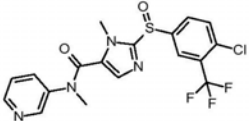
[0758] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物用所述重量份的溶剂溶解,并用含有乳化剂浓度为1000ppm的水补充直到获得所需的浓度。为了制备其他测试浓度,将该制剂用含有乳化剂的水稀释。

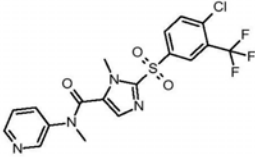
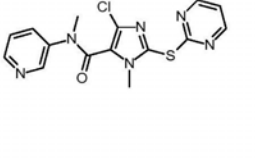
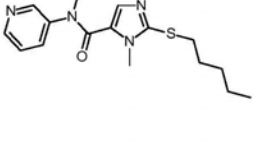
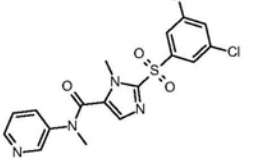
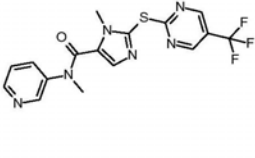
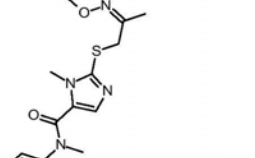
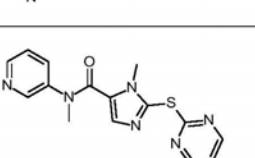
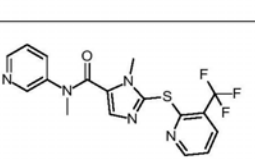
[0759] 向大白菜(白菜(*Brassica pekinensis*))的叶面上喷洒所需浓度的活性化合物制剂,并在干燥后,接种芥菜甲虫(辣根猿叶虫(*Phaedon cochleariae*))的幼虫。

[0760] 在所需时间后,测定以%计的功效。100%意指所有甲虫幼虫都已被杀死;0%意指没有甲虫幼虫被杀死。

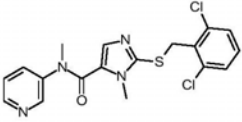
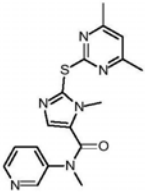
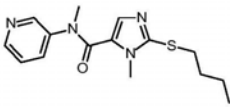
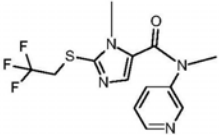
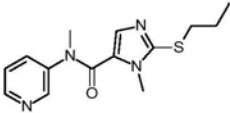
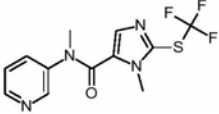
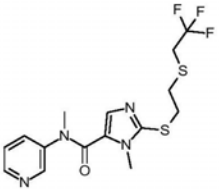
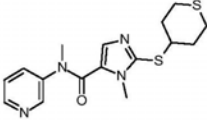
[0761] 在本测试中,与现有技术相比,例如以下制备实施例的化合物显示出优异的功效:见表。

[0762]

物质	结构	动物物种	浓度	%功效	天数
实施例编号 13		PHAECO	500 g ai/ha	0	7 天
现有技术		TETRUR	500 g ai/ha	0	6 天
WO2011/009804		MYZUPE	100 g ai/ha	0	6 天
实施例编号 14		PHAECO	500 g ai/ha	0	7 天
现有技术		TETRUR	500 g ai/ha	0	6 天
WO2011/009804		MYZUPE	100 g ai/ha	0	6 天
实施例编号 I-A-79 本发明		PHAECO	500 g ai/ha	100	7 天

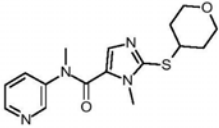
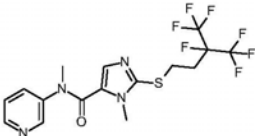
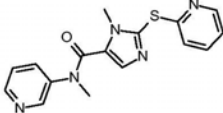
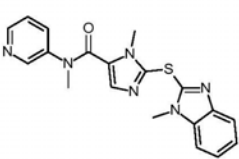
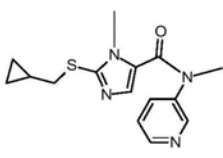
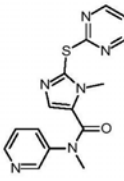
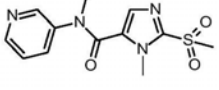
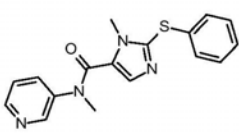
实施例编号 I-A-80 本发明		PHAECO	500 g ai/ha	100	7 天
实施例编号 I-A-15 本发明		PHAECO	500 g ai/ha	83	7 天
实施例编号 I-A-6 本发明		TETRUR MYZUPE	500 g ai/ha 100 g ai/ha	90 90	6 天 6 天
实施例编号 I-A-78 本发明		TETRUR MYZUPE	500 g ai/ha 100 g ai/ha	90 90	6 天 6 天
实施例编号 I-A-105 本发明		TETRUR MYZUPE	500 g ai/ha 100 g ai/ha	90 100	6 天 6 天
实施例编号 I-A-39 本发明		TETRUR	500 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-107 本发明		TETRUR MYZUPE	500 g ai/ha 100 g ai/ha	70 90	6 天 6 天
实施例编号 I-A-110 本发明		TETRUR MYZUPE	500 g ai/ha 100 g ai/ha	70 100	6 天 6 天

[0763]

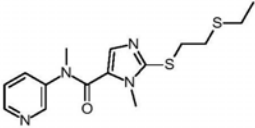
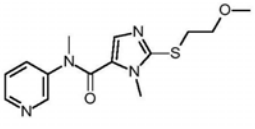
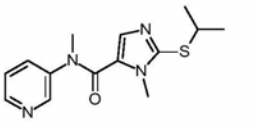
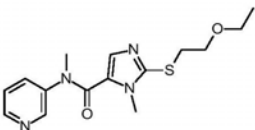
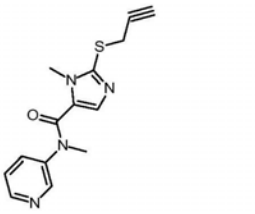
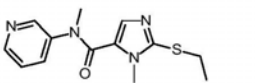
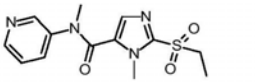
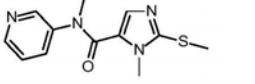
实施例编号 I-A-125 本发明		TETRUR MYZUPE	500 g ai/ha 100 g ai/ha	70 70	6 天 6 天
实施例编号 I-A-1 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	100	6 天
实施例编号 I-A-5 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	100	6 天
实施例编号 I-A-10 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	100	6 天
实施例编号 I-A-21 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	100	6 天
实施例编号 I-A-37 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	100	6 天
实施例编号 I-A-50 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	100	5 天
实施例编号 I-A-51 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	100	5 天

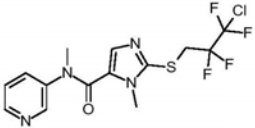
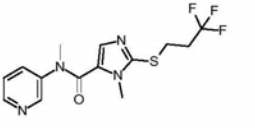
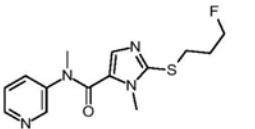
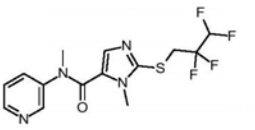
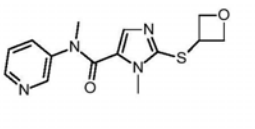
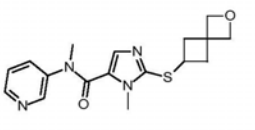
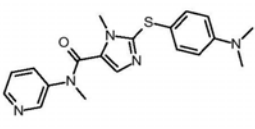
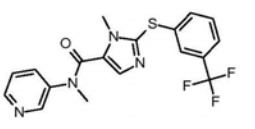
[0764]

[0765]

实施例编号 I-A-52 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	100	5 天
实施例编号 I-A-53 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	100	5 天
实施例编号 I-A-65 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	100	6 天
实施例编号 I-A-134 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	100	5 天
实施例编号 I-A-2 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-3 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-8 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-11 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天

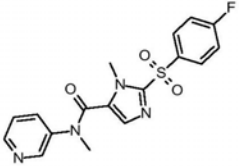
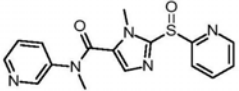
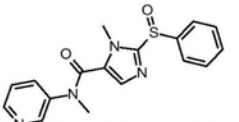
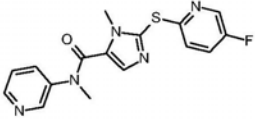
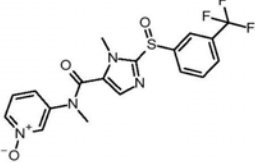
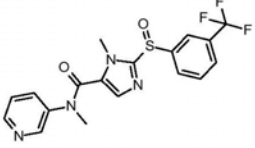
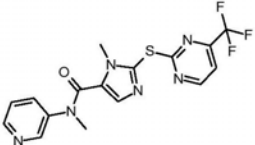
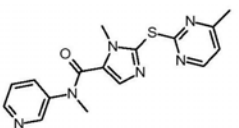
[0766]

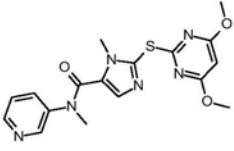
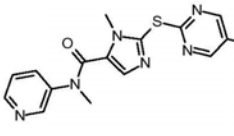
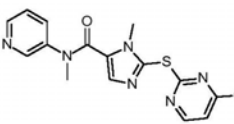
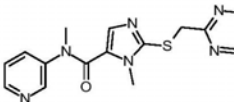
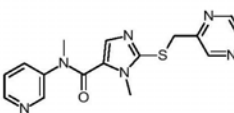
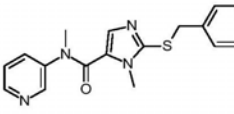
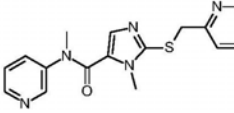
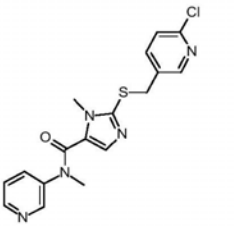
实施例编号 I-A-14 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-18 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-19 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-22 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-30 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-36 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-40 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-45 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天

实施例编号 I-A-46 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 天
实施例编号 I-A-47 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 天
实施例编号 I-A-48 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 天
实施例编号 I-A-49 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 天
实施例编号 I-A-54 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 天
实施例编号 I-A-55 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 天
实施例编号 I-A-59 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-61 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天

[0767]

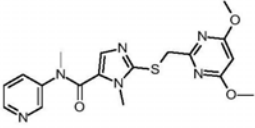
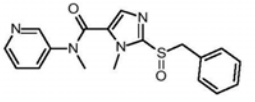
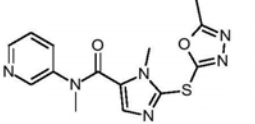
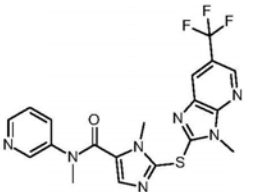
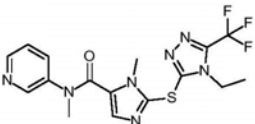
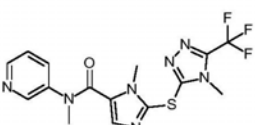
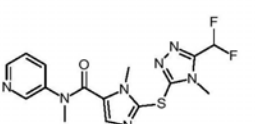
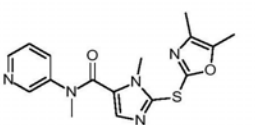
[0768]

实施例编号 I-A-82 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-86 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-87 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-94 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-95 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 天
实施例编号 I-A-96 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 天
实施例编号 I-A-100 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-101 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天

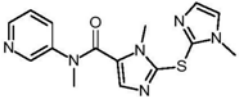
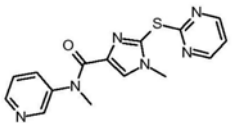
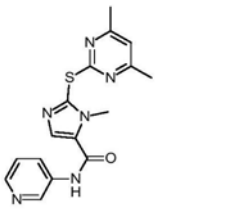
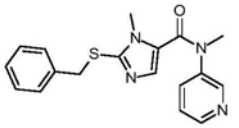
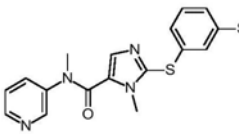
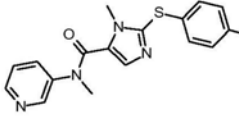
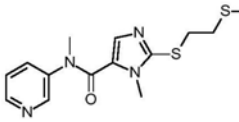
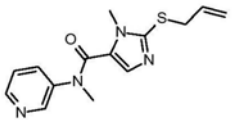
实施例编号 I-A-102 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-104 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-106 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-112 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-113 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-116 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-117 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-122 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天

[0769]

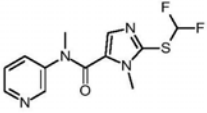
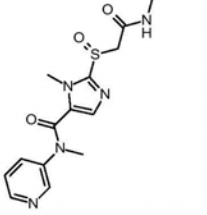
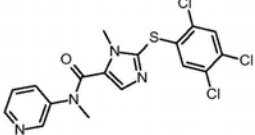
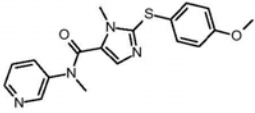
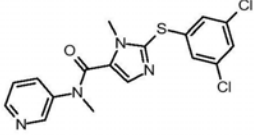
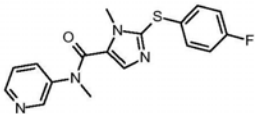
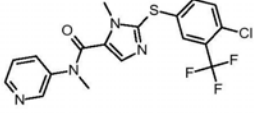
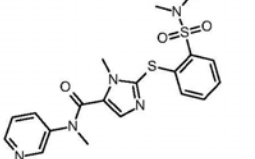
[0770]

实施例编号 I-A-128 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-130 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 天
实施例编号 I-A-135 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 天
实施例编号 I-A-136 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 天
实施例编号 I-A-137 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 天
实施例编号 I-A-138 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 天
实施例编号 I-A-139 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 天
实施例编号 I-A-142 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 天

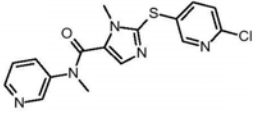
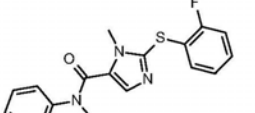
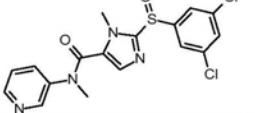
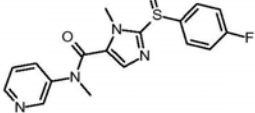
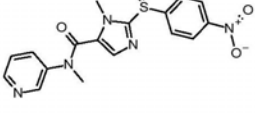
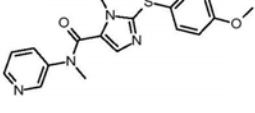
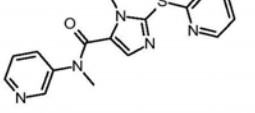
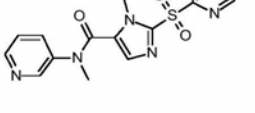
[0771]

实施例编号 I-A-144 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 天
实施例编号 I-B-1 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 天
实施例编号 I-A-4 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-7 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-9 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-12 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-26 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-27 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天

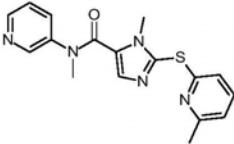
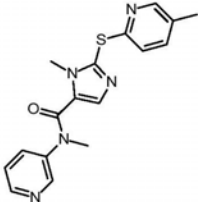
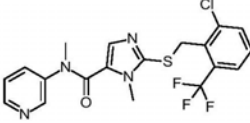
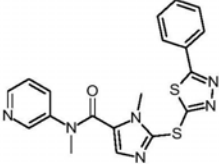
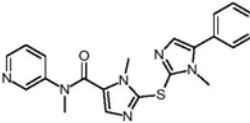
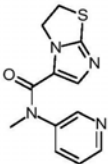
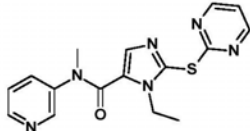
[0772]

实施例编号 I-A-38 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-43 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-56 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-58 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-60 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-62 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-64 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-69 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天

[0773]

实施例编号 I-A-70 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-71 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-77 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-84 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-89 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-93 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-97 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-99 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天

[0774]

实施例编号 I-A-108 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-109 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-126 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 天
实施例编号 I-A-140 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	5 天
实施例编号 I-A-141 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	5 天
实施例编号 I-A-145 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	5 天
实施例编号 I-A-146 本发明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 天