



(12) 发明专利
(全文更正)

(10) 授权公告号 CN 106414441 B9

(45) 授权公告日 2019. 08. 13

(48) 更正文献出版日 2019. 09. 20

(21) 申请号 201580019924. 9

(74) 专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司 11285

(22) 申请日 2015. 02. 05

代理人 钟守期 景莹

(30) 优先权数据

14155372. 7 2014. 02. 17 EP

(51) Int. Cl.

C07D 471/04(2006. 01)

C07D 498/04(2006. 01)

C07D 473/40(2006. 01)

C07D 213/74(2006. 01)

C07D 213/73(2006. 01)

A01N 43/90(2006. 01)

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2016. 10. 14

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/EP2015/052351 2015. 02. 05

(87) PCT国际申请的公布数据

W02015/121136 DE 2015. 08. 20

(56) 对比文件

CN 103261170 A, 2013. 08. 21,

WO 2013018928 A1, 2013. 02. 07,

EP 0079083 A1, 1983. 05. 18, 全文.

(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

审查员 王瑞

(72) 发明人 R·菲舍尔 B·艾丽格 K·伊尔格

O·马萨姆 U·乔金斯 A·特伯格

J·李 S·泽尔什 A·阿尔特

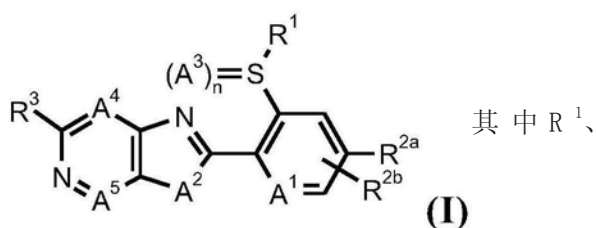
权利要求书 8 页 说明书 98 页

(54) 发明名称

作为害虫防治剂的 2-(杂)芳基-取代的稠合双环杂环衍生物

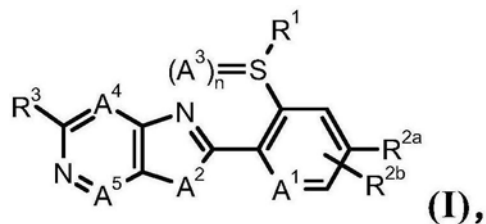
(57) 摘要

本发明涉及新的式(I)的化合物,



R^{2a}、R^{2b}、R³、A¹、A²、A³、A⁴、A⁵和 n 具有本说明书中所示的含义,其作为杀螨剂和 / 或杀昆虫剂用于防治动物害虫的用途,以及用于其制备的方法和中间体产物。

1. 式 (I) 的化合物



其中

A^1 为氮或 $=C-R^4$;

A^2 为 $-N-R^5$ 或氧;

A^3 为氧;

A^4 为氮或 $=C-R^4$;

A^5 为 $=C-H$;

R^1 为 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 卤代烷基、 (C_2-C_6) 羟烷基、 (C_1-C_6) 烷硫基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基磺基、或

R^1 为四氢呋喃基或氧杂环丁烷基, 其各自任选地相同或不同地被卤素、 (C_1-C_6) 烷基或 (C_1-C_6) 卤代烷基单取代或二取代;

R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 和 R^4 各自独立地为氢、氰基、卤素、 (C_1-C_6) 卤代烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、氨基羰基、 $NHCO-(C_1-C_6)$ 烷基 ((C_1-C_6) 烷基羰基氨基), 或

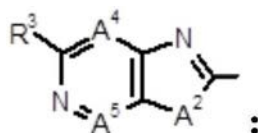
R^5 为苯基、吡啶基或咪唑基, 其各自相同或不同地被单取代或多取代, 其中在每种情况下可能的取代基如下: (C_1-C_6) 卤代烷基;

R^5 为 (C_1-C_6) 烷基;

n 为 0、1 或 2; 以及

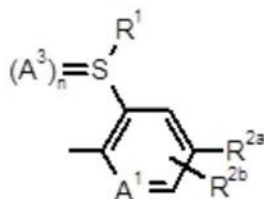
排除式 (I) 的以下化合物, 其由基团 G 和 P 的结合组成;

其中 G 为下表中定义的基团



基团	R^3	A^4	A^5	A^2
G6.002	CF_3	CH	CH	NMe

P 为下表中所定义的基团



基团	R ¹	R ^{2b}	A ¹	R ^{2a}	n	A ³
P1.001	CH ₃	H	N	H	0	O
P1.002	CH ₃	H	N	CF ₃	0	O
P1.003	CH ₃	H	N	Br	0	O
P1.004	CH ₃	H	N	Cl	0	O
P1.005	CH ₃	H	N	H	1	O
P1.006	CH ₃	H	N	CF ₃	1	O
P1.007	CH ₃	H	N	Br	1	O
P1.008	CH ₃	H	N	Cl	1	O
P1.009	CH ₃	H	N	H	2	O
P1.010	CH ₃	H	N	CF ₃	2	O
P1.011	CH ₃	H	N	Br	2	O
P1.012	CH ₃	H	N	Cl	2	O
P1.013	CH ₂ CH ₃	H	N	H	0	O
P1.014	CH ₂ CH ₃	H	N	CF ₃	0	O
P1.015	CH ₂ CH ₃	H	N	Br	0	O
P1.016	CH ₂ CH ₃	H	N	Cl	0	O
P1.017	CH ₂ CH ₃	H	N	H	1	O
P1.018	CH ₂ CH ₃	H	N	CF ₃	1	O
P1.019	CH ₂ CH ₃	H	N	Br	1	O
P1.020	CH ₂ CH ₃	H	N	Cl	1	O
P1.021	CH ₂ CH ₃	H	N	H	2	O
P1.022	CH ₂ CH ₃	H	N	CF ₃	2	O
P1.023	CH ₂ CH ₃	H	N	Br	2	O
P1.024	CH ₂ CH ₃	H	N	Cl	2	O
P1.025	CH ₃	H	CH	H	0	O
P1.026	CH ₃	H	CH	CF ₃	0	O
P1.027	CH ₃	H	CH	Br	0	O
P1.028	CH ₃	H	CH	Cl	0	O
P1.029	CH ₃	H	CH	H	1	O
P1.030	CH ₃	H	CH	CF ₃	1	O
P1.031	CH ₃	H	CH	Br	1	O
P1.032	CH ₃	H	CH	Cl	1	O
P1.033	CH ₃	H	CH	H	2	O
P1.034	CH ₃	H	CH	CF ₃	2	O
P1.035	CH ₃	H	CH	Br	2	O
P1.036	CH ₃	H	CH	Cl	2	O
P1.037	CH ₂ CH ₃	H	CH	H	0	O
P1.038	CH ₂ CH ₃	H	CH	CF ₃	0	O
P1.039	CH ₂ CH ₃	H	CH	Br	0	O
P1.040	CH ₂ CH ₃	H	CH	Cl	0	O
P1.041	CH ₂ CH ₃	H	CH	H	1	O
P1.042	CH ₂ CH ₃	H	CH	CF ₃	1	O
P1.043	CH ₂ CH ₃	H	CH	Br	1	O
P1.044	CH ₂ CH ₃	H	CH	Cl	1	O
P1.045	CH ₂ CH ₃	H	CH	H	2	O
P1.046	CH ₂ CH ₃	H	CH	CF ₃	2	O
P1.047	CH ₂ CH ₃	H	CH	Br	2	O
P1.048	CH ₂ CH ₃	H	CH	Cl	2	O

也排除式 (I) 的以下化合物,

实施例	R ¹	n	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	A ³
V12.05	CH ₂ CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	0	N	CF ₃	H	0
V12.06	CH ₂ CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	0	CH	CF ₃	H	0
V12.07	CH ₂ CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	0	N	H	H	0
V12.08	CH ₂ CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	0	CH	H	H	0
V12.20	CH ₂ CH ₃	2	CH	CH	Br	NMe	N	CF ₃	H	0

2. 权利要求 1 的式 (I) 的化合物, 其中

A¹为氮或 = C-R⁴;

A²为 - N-R⁵或氧;

A³为氧;

A⁴为氮或 = C-R⁴;

A⁵为 = C-H;

R¹为 (C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 羟烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 烷硫基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基-(C₁-C₄) 烷基;或

R¹为四氢呋喃基或氧杂环丁烷基, 其各自任选地相同或不同地被卤素、(C₁-C₄) 烷基或 (C₁-C₄) 卤代烷基单取代或二取代;

R^{2a}、R^{2b}、R³和 R⁴各自独立地为氢、氰基、卤素、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 烷氧基、氨基羰基、NHC(=O)-(C₁-C₄) 烷基 ((C₁-C₄) 烷基羰基氨基), 或

R³为苯基、吡啶基或咪唑基, 其各自相同或不同地被单取代或二取代, 其中在每种情况下可能的取代基如下: (C₁-C₄) 卤代烷基;

R⁵为 (C₁-C₄) 烷基;

n 为 0、1 或 2。

3. 权利要求 1 的式 (I) 的化合物, 其中

A¹为氮或 = C-R⁴;

A²为 - N-R⁵或氧;

A³为氧;

A⁴为氮或 = C-R⁴;

A⁵为 = C-H;

R¹为 (C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 羟烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 烷硫基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基-(C₁-C₄) 烷基;或

R¹为氧杂环丁烷基, 其任选地相同或不同地被卤素、(C₁-C₄) 烷基或 (C₁-C₄) 卤代烷基单取代或二取代;

R^{2a}为氢、氰基、氨基羰基、卤素、(C₁-C₄) 卤代烷基;

R^{2b}为氢、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 卤代烷基、NHC(=O)-(C₁-C₄) 烷基或卤素;

R³为卤素、(C₁-C₄) 卤代烷基, 或为苯基、吡啶基或咪唑基, 其各自任选地被三氟甲基单

取代；

R^4 为氢；

R^5 为 (C_1-C_4) 烷基；

n 为 0、1 或 2。

4. 权利要求 1 的式 (I) 的化合物, 其中

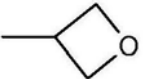
A^1 为氮或 $=C-R^4$;

A^2 为 $-N-R^5$ 或氧；

A^3 为氧；

A^4 为氮或 $=C-H$;

A^5 为 $=C-H$;

R^1 为甲基、乙基、正丙基、异丙基、羟基乙基 $(-CH_2-CH_2-OH)$ 、三氟甲基、氟乙基、二氟乙基、 $-(CH_2)_2-S-C_2H_5$ 、 $-(CH_2)_2-SO_2-C_2H_5$ 或  ;

R^{2a} 为氢、氰基、氨基羰基 $(CONH_2)$ 、三氟甲基、氟或氯；

R^{2b} 为氢、甲氧基、三氟甲基、甲基羰基氨基 $(NHCO-$ 甲基) 或氯；

R^3 为氯、三氟甲基、五氟乙基；或为苯基、吡唑-1-基或咪唑-1-基, 其各自任选地被三氟甲基单取代；

R^4 为氢；

R^5 为甲基；

n 为 0、1 或 2。

5. 权利要求 1 的式 (I) 的化合物, 其中

A^1 为氮 (N) 或 $=C-H$;

A^2 为 $-N-CH_3$ 或氧 (O)；

A^3 为氧；

A^4 为氮 (N) 或 $=C-H$;

A^5 为 $=C-H$;

R^1 为甲基、乙基、正丙基、异丙基、三氟甲基、 $-CH_2-CH_2-F$ 、 $-CH_2-CH_2-OH$ 、 $(CH_2)_2-S-C_2H_5$ 、 $-(CH_2)_2-SO_2-C_2H_5$ 或  ;

R^{2a} 为氢、三氟甲基、氰基、 $CONH_2$ 、氟或氯；

R^{2b} 为氢、氯、三氟甲基、甲氧基或 $NHCOCH_3$;

R^3 为五氟乙基、三氟甲基、氯、 $4-CF_3(C_6H_4)$ 、 $4-(CF_3)$ 吡唑-1-基、 $3-(CF_3)$ 吡唑-1-基或 $4-(CF_3)$ 咪唑-1-基；

n 为 0、1 或 2。

6. 权利要求 1、2、3、4 或 5 中任一项的式 (I) 的化合物, 其中 R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 和 n 各自如权利要求 1、2、3、4 或 5 中任一项的定义, 以及

R^{2b} 为 (C_1-C_6) 烷氧基、 $NHCO-(C_1-C_6)$ 烷基 $((C_1-C_6)$ 烷基羰基氨基)。

7. 权利要求 1、2、3、4 或 5 中任一项的式 (I) 的化合物, 其中 R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5

和 n 各自如权利要求 1、2、3、4 或 5 中任一项的定义, 以及

R^{2b} 为 (C_1-C_4) 烷氧基、 $NHCO-(C_1-C_4)$ 烷基 ((C_1-C_4) 烷基羰基氨基)。

8. 权利要求 1、2、3、4 或 5 中任一项的式 (I) 的化合物, 其中 R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 和 n 各自如权利要求 1、2、3、4 或 5 中任一项的定义, 以及

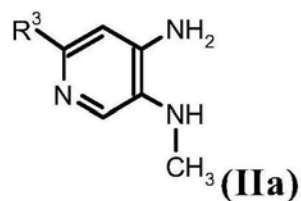
R^{2b} 为甲氧基或 $NHCOCH_3$ 。

9. 组合物, 其特征在于, 包含至少一种权利要求 1 的式 (I) 的化合物以及常规的填充剂和 / 或表面活性剂。

10. 用于防治害虫的方法, 其特征在于, 使权利要求 1 的式 (I) 的化合物或权利要求 9 的组合物作用于害虫和 / 或其生境。

11. 权利要求 1 的式 (I) 的化合物或权利要求 9 的组合物用于防治害虫的用途。

12. 式 (IIa) 的化合物



其中

R^3 为 (C_1-C_4) 卤代烷基, 其中 R^3 不是 CF_3 或 CHF_2 。

13. 权利要求 12 的式 (IIa) 的化合物, 其中

R^3 为 C_2F_5 。

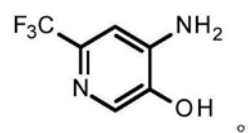
14. 权利要求 1 的式 (I) 的化合物, 其中 R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^4 、 A^5 和 n 定义如下, 并且 A^3 = 氧:

实施例	R ¹	n	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-1	CH ₃	0	N	CH	CF ₃	O	CH	Cl	H
I-4	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	F	H
I-6	CH ₃	0	N	CH	CF ₃	N-甲基	CH	Cl	H
I-7	-(CH ₂) ₂ -SO ₂ - C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-8	i-C ₃ H ₇	1	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-9	C ₂ H ₅	0	N	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-12	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	F	H
I-13	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	H	5-Cl
I-16	i-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-19	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	H	5-Cl
I-20	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	F	H
I-23	-(CH ₂) ₂ -S-C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-27	氧杂环丁烷-3-基	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	H	H
I-28	C ₂ H ₅	0	N	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-29	CF ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	H
I-31	n-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-32	n-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-34	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	Cl	H
I-35	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-38	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	H	5-Cl

实施例	R ¹	n	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-39	n-C ₃ H ₇	1	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-40	氧杂环丁烷-3-基	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-41	i-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-45	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	5-OMe
I-46	C ₂ H ₅	0	CH	CH	C ₂ F ₅	N-甲基	N	H	H
I-47	C ₂ H ₅	0	CH	CH	C ₂ F ₅	N-甲基	N	CF ₃	H
I-48	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	3-CF ₃
I-49	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	5-NHCOMe
I-50	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	5-NHCOMe
I-51	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	3-CF ₃
I-52	C ₂ H ₅	2	CH	CH	Cl	N-甲基	N	CF ₃	H
I-53	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	5-OMe
I-54	CH ₂ -CH ₂ F	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-55	C ₂ H ₅	0	CH	CH	Cl	N-甲基	N	CF ₃	H
I-56	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CONH ₂	H
I-57	CH ₂ -CH ₂ F	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-58	CH ₂ -CH ₂ OH	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-59	CH ₂ -CH ₂ OH	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-60	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CONH ₂	H
I-61	C ₂ H ₅	1	CH	CH	C ₂ F ₅	N-甲基	N	H	H
I-62	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	H	3-Cl
I-63	C ₂ H ₅	1	CH	CH	C ₂ F ₅	N-甲基	N	CF ₃	H
I-64	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-CF ₃ (C ₆ H ₄)	N-甲基	N	CF ₃	H
I-65	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-(CF ₃)吡唑 -1-基	N-甲基	N	CF ₃	H
I-66	n-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	5-OMe
I-67	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	5-OMe
I-68	C ₂ H ₅	2	CH	CH	C ₂ F ₅	N-甲基	N	H	H
I-69	C ₂ H ₅	0	CH	CH	3-(CF ₃)吡唑 -1-基	N-甲基	N	CF ₃	H
I-70	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	3-CF ₃
I-71	n-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	5-OMe
I-72	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CN	H
I-73	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	5-OMe
I-74	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-(CF ₃)咪唑 -1-基	N-甲基	N	CF ₃	H
I-75	C ₂ H ₅	2	CH	CH	4-(CF ₃)咪唑 -1-基	N-甲基	N	CF ₃	H
I-76	C ₂ H ₅	2	CH	CH	4-(CF ₃)吡唑	N-甲基	N	CF ₃	H

实施例	R ¹	n	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
					-1-基				
I-77	C ₂ H ₅	2	CH	CH	3-(CF ₃)吡唑 -1-基	N-甲基	N	CF ₃	H

15. 式 (II-02) 的化合物



作为害虫防治剂的 2-(杂)芳基-取代的稠合双环杂环衍生物

[0001] 本发明涉及新的式 (I) 的 2-(杂)芳基-取代的稠合双环杂环衍生物,涉及其作为用于防治动物害虫、特别是节肢动物且尤其是昆虫和蛛形纲动物的杀螨剂和/或杀昆虫剂的用途,以及涉及制备其的方法和中间体。

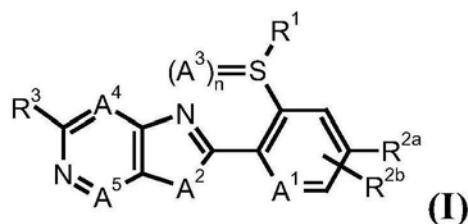
[0002] 具有杀虫性能的 2-(杂)芳基-取代的稠合双环杂环衍生物已记载于下列文献中:例如 WO 2010/125985、WO 2012/074135、WO 2012/086848、WO 2013/018928、WO 2014/142292 和 WO 2014/148451, 以及 WO 2015/000715。

[0003] 然而,根据上述引用文献已知的活性成分在应用上具有一些缺点,无论是因为它们仅表现出较窄的应用范围还是因为它们不具有令人满意的杀虫或杀螨活性。

[0004] 现已发现新的 2-(杂)芳基-取代的稠合双环杂环衍生物,并且它们比已知化合物具有优点,其优点的实例为更好的生物或环境特性、更宽范围的施用方法、更好的杀虫或杀螨活性以及与作物植物更好的相容性。2-(杂)芳基-取代的稠合双环杂环衍生物可结合其他试剂使用,以提高功效,尤其是抵抗难以防治的昆虫的功效。

[0005] 因此本发明提供了新的式 (I) 的化合物

[0006]



[0007] 其中

[0008] A^1 为氮、 $=N^+-O^-$ 或 $=C-R^4$;

[0009] A^2 为 $-N-R^5$ 、氧或硫;

[0010] A^3 为氧、 $=N-H$ 或 $=N-CN$;

[0011] A^4 为氮、 $=N^+-O^-$ 或 $=C-R^4$;

[0012] A^5 为氮、 $=N^+-O^-$ 或 $=C-R^4$;

[0013] R^1 为 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 卤代烷基、 (C_1-C_6) 氰基烷基、 (C_2-C_6) 羟烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 卤代烷氧基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 烯氧基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 卤代烯氧基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 卤代烯基、 (C_2-C_6) 氰基烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_2-C_6) 炔氧基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 卤代炔氧基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 卤代炔基、 (C_2-C_6) 氰基炔基、 (C_3-C_8) 环烷基、 (C_3-C_8) 环烷基、 (C_3-C_8) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_8) 环烷基、卤代 (C_3-C_8) 环烷基、氨基、 (C_1-C_6) 烷基氨基、二 (C_1-C_6) 烷基氨基、 (C_3-C_8) 环烷基氨基、 (C_1-C_6) 烷基羰基氨基、 (C_1-C_6) 烷硫基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 卤代烷硫基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷硫基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基

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

[0014] 或为(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₃-C₈) 环烷基,其各自相同或不同地被芳基、杂芳基或杂环基单取代或多取代,其中芳基、杂芳基或杂环基可各自独立地相同或不同地被下列基团单取代或多取代:卤素、氰基、硝基、羟基、氨基、羧基、氨基甲酰基、氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 烷基硫基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基硫代亚氨基(alkylsulphimino)、(C₁-C₆) 烷基硫代亚氨基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基硫代亚氨基-(C₂-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基硫代肟基(alkylsulphoximino)、(C₁-C₆) 烷基硫代肟基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基硫代肟基-(C₂-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₃-C₆) 三烷基甲硅烷基或苄基;或

[0015] R¹为芳基、杂芳基或杂环基,其各自相同或不同地被下列基团单取代或多取代:卤素、氰基、硝基、羟基、氨基、羧基、氨基甲酰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 烷基硫基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基硫代亚氨基、(C₁-C₆) 烷基硫代亚氨基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基硫代亚氨基-(C₂-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基硫代肟基、(C₁-C₆) 烷基硫代肟基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基硫代肟基-(C₂-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₃-C₆) 三烷基甲硅烷基、(=O)(仅在杂环基的情况下)或(=O)₂(仅在杂环基的情况下);

[0016] R^{2a}、R^{2b}、R³和 R⁴各自独立地为氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三-(C₁-C₆) 烷基甲硅烷基、(C₃-C₈) 环烷基、(C₃-C₈) 环烷基-(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基-(C₃-C₈) 环烷基、卤代(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷基、(C₁-C₆) 氰基烷基、(C₁-C₆) 羟烷基、羟基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 卤代烯基、(C₂-C₆) 氰基烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₂-C₆) 卤代炔基、(C₂-C₆) 氰基炔基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 氰基烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 卤代烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷基硫基、(C₁-C₆) 卤代烷基硫基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基硫基、(C₁-C₆) 烷基硫基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基硫基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、二(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、二(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆) 烷基氨基、二(C₁-C₆) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、二(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基硫代肟基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基,

[0017] 为芳基或杂芳基,其各自相同或不同地被单取代或多取代,其中(在杂芳基的情况下)可任选地存在至少一个羰基基团和/或其中在每种情况下可能的取代基如下:氰基、羧基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三-(C₁-C₆)烷基甲硅烷基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)卤代烷基、(C₁-C₆)氰基烷基、(C₁-C₆)羟烷基、羟基羰基-(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯基、(C₂-C₆)卤代烯基、(C₂-C₆)氰基烯基、(C₂-C₆)炔基、(C₂-C₆)卤代炔基、(C₂-C₆)氰基炔基、(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)卤代烷氧基、(C₁-C₆)氰基烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基-(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆)烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)烷基-(C₁-C₆)烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)卤代烷基-(C₁-C₆)烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)卤代烷硫基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷硫基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、(C₁-C₆)卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆)烷基羰基、(C₁-C₆)卤代烷基羰基、(C₁-C₆)烷基羰基氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基、(C₁-C₆)卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆)烷基氨基羰基、二(C₁-C₆)烷基氨基羰基、(C₂-C₆)烯基氨基羰基、二(C₂-C₆)-烯基氨基羰基、(C₃-C₈)环烷基氨基羰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆)烷基氨基磺酰基、二(C₁-C₆)烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆)烷基硫代脒基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆)烷基氨基硫代羰基、二(C₁-C₆)烷基氨基硫代羰基、(C₃-C₈)环烷基氨基;

[0018] R⁵为(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)卤代烷基、(C₁-C₆)氰基烷基、(C₁-C₆)羟烷基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)卤代烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯基、(C₂-C₆)烯氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)卤代烯氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)卤代烯基、(C₂-C₆)氰基烯基、(C₂-C₆)炔基、(C₂-C₆)炔氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)卤代炔氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)卤代炔基、(C₂-C₆)氰基炔基、(C₃-C₈)环烷基、(C₃-C₈)环烷基-(C₃-C₈)环烷基、(C₁-C₆)烷基-(C₃-C₈)环烷基、卤代(C₃-C₈)环烷基、(C₁-C₆)烷硫基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)卤代烷硫基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)卤代烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基磺酰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)卤代烷基磺酰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷硫基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基磺酰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)卤代烷基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)卤代烷氧基羰基-(C₁-C₆)烷基、氨基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基氨基-(C₁-C₆)烷基、二(C₁-C₆)烷基氨基-(C₁-C₆)烷基或(C₃-C₈)环烷基氨基-(C₁-C₆)烷基;

[0019] n为0、1或2,

[0020] 其中在n=2的情况下,A³的含义可以相同或不同。

[0021] 另外已经发现式(I)的化合物作为农药、优选作为杀昆虫剂和/或杀螨剂具有非常好的功效;并且还通常具有非常好的植物相容性,尤其是对于作物植物。

[0022] 本发明的化合物一般来说通过式(I)来定义。在上文和下文式中给出的优选取代基或基团范围在下文中说明:

[0023] A¹优选为氮、=N⁺-O⁻或=C-R⁴;

[0024] A^2 优选为 $-N-R^5$ 、氧或硫；

[0025] A^3 优选为氧、 $=N-H$ 或 $=N-CN$ ；

[0026] A^4 优选为氮、 $=N^+-O^-$ 或 $=C-R^4$ ；

[0027] A^5 优选为氮、 $=N^+-O^-$ 或 $=C-R^4$ ；

[0028] R^1 优选为 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 氰基烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 烯氧基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 卤代烯氧基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 卤代烯基、 (C_2-C_4) 氰基烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_2-C_4) 炔氧基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 卤代炔氧基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 卤代炔基、 (C_2-C_4) 氰基炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、卤代 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基氨基、二 (C_1-C_4) 烷基氨基、 (C_3-C_6) 环烷基氨基、 (C_1-C_4) 烷基羰基氨基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基羰基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基羰基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氨基，

[0029] 或为 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_3-C_6) 环烷基，其各自相同或不同地被芳基、杂芳基或杂环基单取代或二取代，其中芳基、杂芳基和杂环基可各自任选地相同或不同地被下列基团单取代或二取代：卤素、氰基、氨基甲酰基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基硫代亚氨基；或

[0030] R^1 优选为芳基、杂芳基或杂环基，其各自任选地相同或不同地被下列基团单取代或二取代：卤素、氰基、氨基甲酰基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基硫代亚氨基、 (C_1-C_4) 烷基硫代肟基、 (C_1-C_4) 烷基羰基、 (C_3-C_4) 三烷基甲硅烷基、 $(=O)$ （仅在杂环基的情况下）或 $(=O)_2$ （仅在杂环基的情况下）；

[0031] R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 和 R^4 优选各自独立地为氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三 (C_1-C_4) 烷基甲硅烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、卤代 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 氰基烷基、 (C_1-C_4) 羟烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 卤代烯基、 (C_2-C_4) 氰基烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_2-C_4) 卤代炔基、 (C_2-C_4) 氰基炔基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) 氰基烷氧基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷基羟基亚氨基、 (C_1-C_4) 烷氧基亚氨基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基亚氨基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基亚氨基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 卤代烷硫基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氧基、 (C_1-C_4) 烷基羰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基羰基、氨基羰基、氨基硫代羰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、二 (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氨基、 (C_1-C_4) 烷基氨基、二 (C_1-C_4) 烷基氨基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基、二 (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基、氨基硫代羰基，

[0032] 为苯基或杂芳基，其各自相同或不同地被单取代或二取代，其中（在杂芳基的情况下）可任选地存在至少一个羰基基团和/或其中在每种情况下可能的取代基如下：氰基、

卤素、硝基、乙酰基、氨基、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 氰基烷基、(C₁-C₄) 羟烷基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 烯基、(C₂-C₄) 卤代烯基、(C₂-C₄) 氰基烯基、(C₂-C₄) 炔基、(C₂-C₄) 卤代炔基、(C₂-C₄) 氰基炔基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 卤代烷氧基、(C₁-C₄) 氰基烷氧基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷基-(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 卤代烷基-(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷硫基、(C₁-C₄) 卤代烷硫基、(C₁-C₄) 烷硫基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₄) 烷基羰基、(C₁-C₄) 卤代烷基羰基、氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、二(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₄) 烷基氨基、二(C₁-C₄) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、二(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基；

[0033] R⁵优选为(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 氰基烷基、(C₁-C₄) 羟烷基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 烯基、(C₂-C₄) 烯氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 卤代烯氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 卤代烯基、(C₂-C₄) 氰基烯基、(C₂-C₄) 炔基、(C₂-C₄) 炔氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 卤代炔基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₃-C₆) 环烷基-(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷基-(C₃-C₆) 环烷基、卤代(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷硫基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷硫基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基亚磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷硫基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基羰基-(C₁-C₄) 烷基；

[0034] n 为 0、1 或 2，

[0035] 其中在 n = 2 的情况下，A³的含义可相同或不同。

[0036] A¹更优选为氮或 = C-R⁴；

[0037] A²更优选为 - N-R⁵或氧；

[0038] A³更优选为氧或 = N-H；

[0039] A⁴更优选为氮或 = C-R⁴；

[0040] A⁵更优选为氮或 = C-R⁴；

[0041] R¹更优选为(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₂-C₄) 烯基、(C₂-C₄) 卤代烯基、(C₂-C₄) 炔基、(C₂-C₄) 卤代炔基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷硫基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基-(C₁-C₄) 烷基，

[0042] 或为(C₁-C₄) 烷基，其任选地被苯基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、吡唑基、三唑基、噻唑基、四唑基、哌嗪基、四氢呋喃基或氧杂环丁烷基单取代，其中苯基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、吡唑基、三唑基、噻唑基、四唑基、哌嗪基、四氢呋喃基或氧杂环丁烷基可各自任选地相同或不同地被卤素、(C₁-C₄) 烷基或(C₁-C₄) 卤代烷基单取代或二取代；或

[0043] R¹更优选为苯基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、吡唑基、三唑基、噻唑基、四唑基、哌嗪基、四氢呋喃基或氧杂环丁烷基，其各自任选地相同或不同地被卤素、(C₁-C₄) 烷基或(C₁-C₄) 卤代烷基单取代或二取代；

[0044] R^{2a}更优选为氢、卤素、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 烷硫基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷硫基、(C₁-C₄) 卤代烷基亚磺酰基或(C₁-C₄)

卤代烷基磺酰基；

[0045] R^{2b} 更优选为氢或卤素；

[0046] R^3 更优选为氢、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基磺基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基或 (C_1-C_4) 卤代烷基磺酰基；

[0047] R^4 更优选为氢、卤素、氰基或 (C_1-C_3) 烷基；

[0048] R^5 更优选为 (C_1-C_4) 烷基或 (C_1-C_4) 烷氧基 - (C_1-C_4) 烷基；

[0049] n 更优选为 0、1 或 2，

[0050] 其中在 $n = 2$ 的情况下， A^3 的含义可相同或不同。

[0051] A^1 甚至更优选为氮或 $=C-R^4$ ；

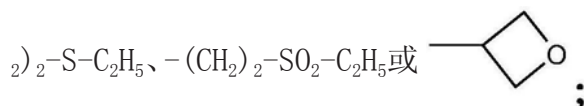
[0052] A^2 甚至更优选为 $-N-R^5$ 或氧；

[0053] A^3 甚至更优选为氧；

[0054] A^4 甚至更优选为氮或 $=C-H$ ；

[0055] A^5 甚至更优选为氮或 $=C-H$ ；

[0056] R^1 甚至更优选为甲基、乙基、正丙基、异丙基、环丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、环丁基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟乙基、二氟乙基、三氟乙基、四氟乙基、五氟乙基、 $-(CH_2)_2-S-C_2H_5$ 、 $-(CH_2)_2-SO_2-C_2H_5$ 或



[0057] R^{2a} 甚至更优选为氢、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟乙基、二氟乙基、三氟乙基、四氟乙基、五氟乙基、三氟甲硫基、三氟甲基磺酰基、三氟甲基亚磺酰基、氟或氯；

[0058] R^{2b} 甚至更优选为氢、氟或氯；

[0059] R^3 甚至更优选为氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟乙基、二氟乙基、三氟乙基、四氟乙基、五氟乙基、三氟甲硫基、三氟甲基磺酰基或三氟甲基亚磺酰基；

[0060] R^4 甚至更优选为氢、氟、氯、溴或氰基；

[0061] R^5 甚至更优选为甲基、乙基、异丙基、甲氧基甲基或甲氧基乙基；

[0062] n 甚至更优选为 0、1 或 2。

[0063] A^1 特别是氮 (N) 或 $=C-H$ ；

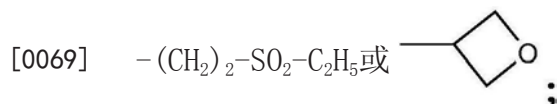
[0064] A^2 特别是 $-N-CH_3$ 或氧 (O)；

[0065] A^3 特别是氧 (O)；

[0066] A^4 特别是氮 (N) 或 $=C-H$ ；

[0067] A^5 特别是 $=C-H$ ；

[0068] R^1 特别是甲基、乙基、正丙基、异丙基、三氟甲基、 $-(CH_2)_2-S-C_2H_5$ 、



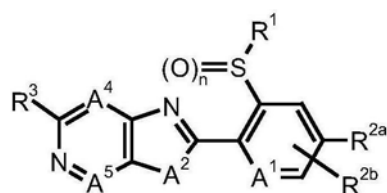
[0070] R^{2a} 特别是氢、三氟甲基、氟或氯；

[0071] R^{2b} 特别是氢或氯；

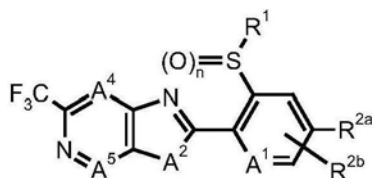
[0072] R^3 特别是三氟甲基；

[0073] n 特别是 0、1 或 2。

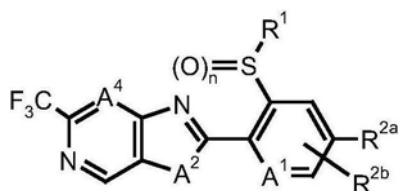
[0074] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-A) 的化合物
[0075]



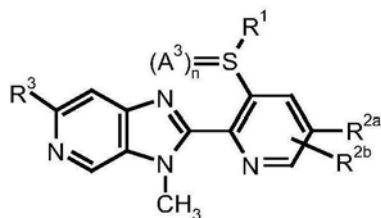
[0076] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-B) 的化合物
[0077]



[0078] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-C) 的化合物
[0079]



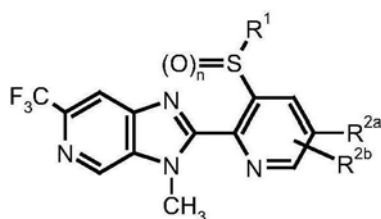
[0080] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-D) 的化合物
[0081]



[0082] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-E) 的化合物
[0083]

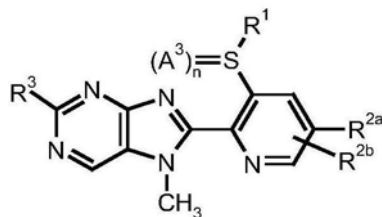


[0084] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-F) 的化合物
[0085]



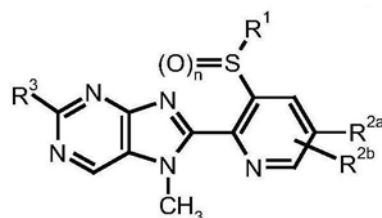
[0086] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-G) 的化合物

[0087]



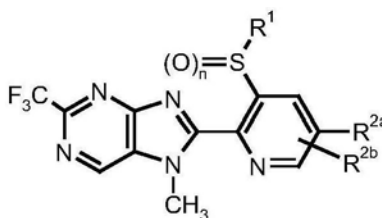
[0088] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-H) 的化合物

[0089]



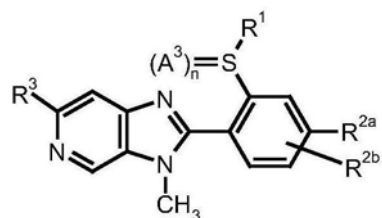
[0090] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-I) 的化合物

[0091]



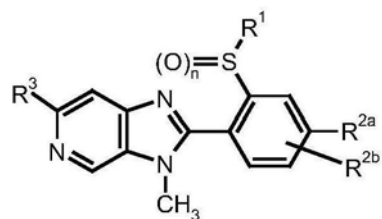
[0092] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-J) 的化合物

[0093]



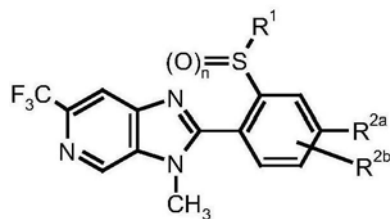
[0094] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-K) 的化合物

[0095]



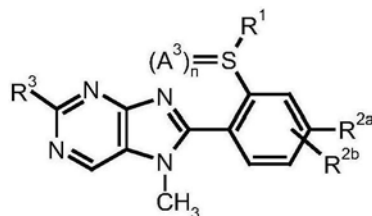
[0096] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-L) 的化合物

[0097]



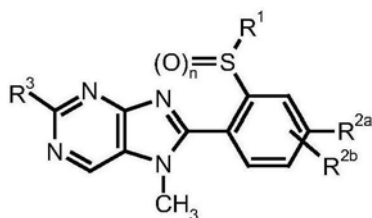
[0098] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-M) 的化合物

[0099]



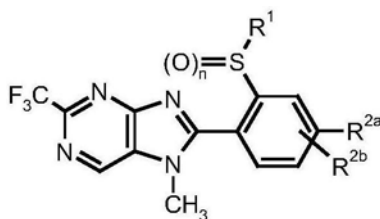
[0100] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-N) 的化合物

[0101]



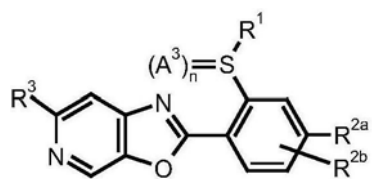
[0102] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-O) 的化合物

[0103]



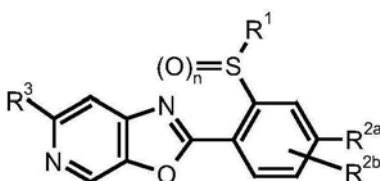
[0104] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-P) 的化合物

[0105]



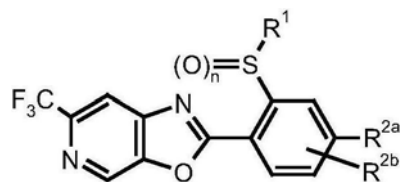
[0106] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-Q) 的化合物

[0107]

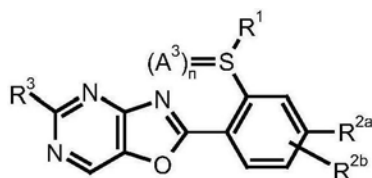


[0108] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-R) 的化合物

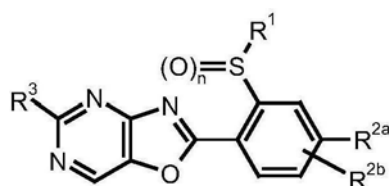
[0109]



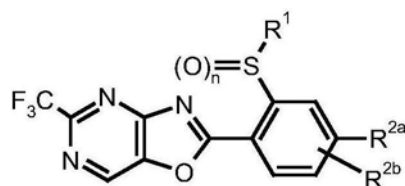
[0110] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-S) 的化合物
[0111]



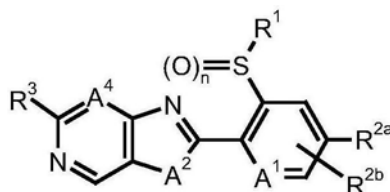
[0112] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-T) 的化合物
[0113]



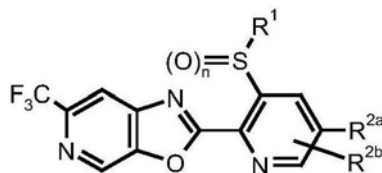
[0114] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-U) 的化合物
[0115]



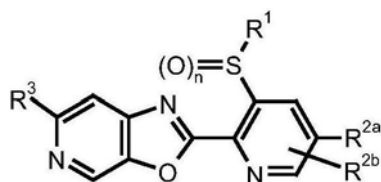
[0116] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-V) 的化合物
[0117]



[0118] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-W) 的化合物
[0119]



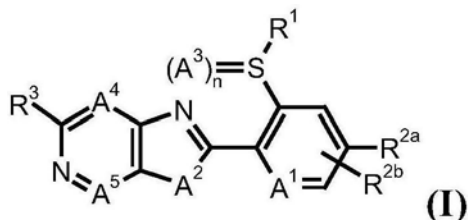
[0120] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I-X) 的化合物
[0121]



[0122] 在式 (I-A) 至 (I-X) 中, R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 和 n 基团各自如上文定义。

[0123] 在另一实施方案 (构型 1) 中, 本发明涉及式 (I) 的化合物

[0124]



[0125] 其中

[0126] A^1 为氮、 $=N^+-O^-$ 或 $=C-R^4$;

[0127] A^2 为 $-N-R^5$ 、氧或硫;

[0128] A^3 为氧;

[0129] A^4 为氮、 $=N^+-O^-$ 或 $=C-R^4$;

[0130] A^5 为 $=C-H$;

[0131] R^1 为 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 卤代烷基、 (C_1-C_6) 氰基烷基、 (C_2-C_6) 羟烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 卤代烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 烯氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 卤代烯氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 卤代烯基、 (C_2-C_6) 氰基烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_2-C_6) 炔氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 卤代炔氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 卤代炔基、 (C_2-C_6) 氰基炔基、 (C_3-C_8) 环烷基、 (C_3-C_8) 环烷基- (C_3-C_8) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷基- (C_3-C_8) 环烷基、卤代 (C_3-C_8) 环烷基、氨基、 (C_1-C_6) 烷基氨基、二 (C_1-C_6) 烷基氨基、 (C_3-C_8) 环烷基氨基、 (C_1-C_6) 烷基羰基氨基、 (C_1-C_6) 烷硫基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 卤代烷硫基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 卤代烷基亚磺酰基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 卤代烷基磺酰基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷硫基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基磺酰基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷基羰基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 卤代烷基羰基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 卤代烷氧基羰基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基氨基、氨基磺酰基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷基氨基磺酰基- (C_1-C_6) 烷基、二 (C_1-C_6) 烷基氨基磺酰基- (C_1-C_6) 烷基,

[0132] 或为在每种情况下相同或不同地任选地被单芳基或多芳基、杂芳基或杂环基-取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_3-C_8) 环烷基, 其中芳基、杂芳基或杂环基可各自独立地相同或不同地被下列基团单取代或多取代: 卤素、氰基、硝基、羟基、氨基、羧基、氨基甲酰基、氨基磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 卤代烷基、 (C_1-C_6) 卤代烷氧基、 (C_1-C_6) 烷硫基、 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基硫代亚氨基、 (C_1-C_6) 烷基硫代亚氨基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷基硫代亚氨基- (C_2-C_6) 烷基羰基、 (C_1-C_6) 烷基硫代脒基、 (C_1-C_6) 烷基硫代脒基- (C_1-C_6) 烷基、

(C₁-C₆) 烷基硫代脞基-(C₂-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₃-C₆) 三烷基甲硅烷基或苄基 ;或

[0133] R¹为芳基、杂芳基或杂环基,其各自任选地相同或不同地被下列基团单取代或多取代:卤素、氰基、硝基、羟基、氨基、羧基、氨基甲酰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 烷基硫基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基硫代亚氨基、(C₁-C₆) 烷基硫代亚氨基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基硫代亚氨基-(C₂-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基硫代脞基、(C₁-C₆) 烷基硫代脞基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基硫代脞基-(C₂-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₃-C₆) 三烷基甲硅烷基、(=O)(仅在杂环基的情况下)或(=O)₂(仅在杂环基的情况下);

[0134] R^{2a}、R^{2b}、R³和 R⁴各自独立地为氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三-(C₁-C₆) 烷基甲硅烷基、(C₃-C₈) 环烷基、(C₃-C₈) 环烷基-(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基-(C₃-C₈) 环烷基、卤代(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷基、(C₁-C₆) 氰基烷基、(C₁-C₆) 羟烷基、羟基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 卤代烯基、(C₂-C₆) 氰基烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₂-C₆) 卤代炔基、(C₂-C₆) 氰基炔基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 氰基烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 卤代烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷基硫基、(C₁-C₆) 卤代烷基硫基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基硫基、(C₁-C₆) 烷基硫基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基硫基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、二(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、二(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆) 烷基氨基、二(C₁-C₆) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、二(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基硫代脞基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基、NHC(O)-(C₁-C₆) 烷基((C₁-C₆) 烷基羰基氨基),

[0135] 为芳基或杂芳基,其各自任选地相同或不同地被单取代或多取代,其中(在杂芳基的情况下)可任选地存在至少一个羰基基团和/或其中在每种情况下可能的取代基如下:氰基、羧基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三-(C₁-C₆) 烷基甲硅烷基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷基、(C₁-C₆) 氰基烷基、(C₁-C₆) 羟烷基、羟基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 卤代烯基、(C₂-C₆) 氰基烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₂-C₆) 卤代炔基、(C₂-C₆) 氰基炔基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 氰基烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 卤代烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷基硫基、(C₁-C₆) 卤代烷基

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

[0136] R⁵为(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷基、(C₁-C₆) 氰基烷基、(C₁-C₆) 羟烷基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 烯氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 卤代烯氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 卤代烯基、(C₂-C₆) 氰基烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₂-C₆) 炔氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 卤代炔氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 卤代炔基、(C₂-C₆) 氰基炔基、(C₃-C₈) 环烷基、(C₃-C₈) 环烷基-(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基-(C₃-C₈) 环烷基、卤代(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷硫基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷硫基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷基亚磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷基磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷硫基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷基、氨基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基氨基-(C₁-C₆) 烷基、二(C₁-C₆) 烷基氨基-(C₁-C₆) 烷基或(C₃-C₈) 环烷基氨基-(C₁-C₆) 烷基；

[0137] n 为 0、1 或 2。

[0138] 优选(构型 2) 式(I) 的化合物, 其中

[0139] A¹为氮、= N⁺-O⁻或= C-R⁴；

[0140] A²为 -N-R⁵、氧或硫；

[0141] A³为氧；

[0142] A⁴为氮、= N⁺-O⁻或= C-R⁴；

[0143] A⁵为= C-H；

[0144] R¹为(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 羟烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 氰基烷基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 烯基、(C₂-C₄) 烯氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 卤代烯氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 卤代烯基、(C₂-C₄) 氰基烯基、(C₂-C₄) 炔基、(C₂-C₄) 炔氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 卤代炔氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 卤代炔基、(C₂-C₄) 氰基炔基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₃-C₆) 环烷基-(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷基-(C₃-C₆) 环烷基、卤代(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷基氨基、二(C₁-C₄) 烷基氨基、(C₃-C₆) 环烷基氨基、(C₁-C₄) 烷基羰基氨基、(C₁-C₄) 烷硫基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷硫基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基亚磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基羰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基羰基-(C₁-C₄) 烷基、

(C₁-C₄) 烷基磺酰基氨基,

[0145] 或为 (C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₂-C₄) 烯基、(C₂-C₄) 炔基、(C₃-C₆) 环烷基, 其各自相同或不同地被芳基、杂芳基或杂环基基团单取代或二取代, 其中芳基、杂芳基或杂环基可各自任选地相同或不同地被下列基团单取代或二取代: 卤素、氰基、氨基甲酰基、氨基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 卤代烷氧基、(C₁-C₄) 烷硫基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基硫代亚氨基; 或

[0146] R¹为芳基、杂芳基或杂环基, 其各自任选相同或不同地被下列基团单取代或二取代: 卤素、氰基、氨基甲酰基、(C₁-C₄) 烷基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 卤代烷氧基、(C₁-C₄) 烷硫基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基硫代亚氨基、(C₁-C₄) 烷基硫代脲基、(C₁-C₄) 烷基羰基、(C₃-C₄) 三烷基甲硅烷基、(= 0) (仅在杂环基的情况下) 或 (= O)₂ (仅在杂环基的情况下) ;

[0147] R^{2a}、R^{2b}、R³和 R⁴各自独立地为氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三 - (C₁-C₄) 烷基甲硅烷基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₃-C₆) 环烷基 - (C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷基 - (C₃-C₆) 环烷基、卤代 (C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 氰基烷基、(C₁-C₄) 羟烷基、(C₁-C₄) 烷氧基 - (C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 烯基、(C₂-C₄) 卤代烯基、(C₂-C₄) 氰基烯基、(C₂-C₄) 炔基、(C₂-C₄) 卤代炔基、(C₂-C₄) 氰基炔基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 卤代烷氧基、(C₁-C₄) 氰基烷氧基、(C₁-C₄) 烷氧基 - (C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷基 - (C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 卤代烷基 - (C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷硫基、(C₁-C₄) 卤代烷硫基、(C₁-C₄) 烷硫基 - (C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基 - (C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基 - (C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₄) 烷基羰基、(C₁-C₄) 卤代烷基羰基、氨基羰基、氨基硫代羰基、(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、二 (C₁-C₄) 烷基氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₄) 烷基氨基、二 (C₁-C₄) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、二 (C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、氨基硫代羰基、NHCO - (C₁-C₄) 烷基 ((C₁-C₄) 烷基羰基氨基),

[0148] 为苯基或杂芳基, 其各自相同或不同地被单取代或二取代, 其中 (在杂芳基的情况下) 可任选地存在至少一个羰基基团和 / 或其中在每种情况下可能的取代基如下: 氰基、卤素、硝基、乙酰基、氨基、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 氰基烷基、(C₁-C₄) 羟烷基、(C₁-C₄) 烷氧基 - (C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 烯基、(C₂-C₄) 卤代烯基、(C₂-C₄) 氰基烯基、(C₂-C₄) 炔基、(C₂-C₄) 卤代炔基、(C₂-C₄) 氰基炔基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 卤代烷氧基、(C₁-C₄) 氰基烷氧基、(C₁-C₄) 烷氧基 - (C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷基 - (C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 卤代烷基 - (C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷硫基、(C₁-C₄) 卤代烷硫基、(C₁-C₄) 烷硫基 - (C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基 - (C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基 - (C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₄) 烷基羰基、(C₁-C₄) 卤代烷基羰基、氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、二 (C₁-C₄) 烷基氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₄) 烷基氨基、二 (C₁-C₄) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、二 (C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基;

[0149] R^5 为 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 氰基烷基、 (C_1-C_4) 羟烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 烯氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 卤代烯氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 卤代烯基、 (C_2-C_4) 氰基烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_2-C_4) 炔氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 卤代炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基- (C_3-C_6) 环烷基、卤代 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷硫基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基羰基- (C_1-C_4) 烷基；

[0150] n 为 0、1 或 2。

[0151] 特别优选（构型 3）式（I）的化合物，其中

[0152] A^1 为氮或 $=C-R^4$ ；

[0153] A^2 为 $-N-R^5$ 或氧；

[0154] A^3 为氧；

[0155] A^4 为氮或 $=C-R^4$ ；

[0156] A^5 为 $=C-H$ ；

[0157] R^1 为 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 羟烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 卤代烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_2-C_4) 卤代炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基- (C_1-C_4) 烷基，

[0158] 或为 (C_1-C_4) 烷基，其任选地被苯基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、吡唑基、三唑基、噻唑基、四唑基、哌嗪基、四氢呋喃基或氧杂环丁烷基单取代，其中苯基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、吡唑基、三唑基、噻唑基、四唑基、哌嗪基、四氢呋喃基或氧杂环丁烷基可各自任选地相同或不同地被卤素、 (C_1-C_4) 烷基或 (C_1-C_4) 卤代烷基单取代或二取代；或

[0159] R^1 为苯基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、吡唑基、三唑基、噻唑基、四唑基、哌嗪基、四氢呋喃基或氧杂环丁烷基，其各自任选地相同或不同地被卤素、 (C_1-C_4) 烷基或 (C_1-C_4) 卤代烷基单取代或二取代；

[0160] R^{2a} 为氢、氰基、氨基羰基、卤素、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷硫基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基或 (C_1-C_4) 卤代烷基磺酰基；

[0161] R^{2b} 为氢、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 $NHCO-(C_1-C_4)$ 烷基或卤素；

[0162] R^3 为氢、卤素、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷硫基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基磺酰基，或为苯基、吡唑基或咪唑基，其各自任选地被三氟甲基单取代；

[0163] R^4 为氢、卤素、氰基或 (C_1-C_3) 烷基；

[0164] R^5 为 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基；

[0165] n 为 0、1 或 2。

[0166] 非常特别优选（构型 4）式（I）的化合物，其中

[0167] A^1 为氮或 $=C-R^4$ ；

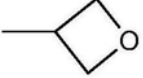
[0168] A^2 为 $-N-R^5$ 或氧；

[0169] A^3 为氧；

[0170] A^4 为氮或 $=C-H$ ；

[0171] A^5 为 $=C-H$ ；

[0172] R^1 为甲基、乙基、正丙基、异丙基、环丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、环丁基、羟基乙基 ($-CH_2-CH_2-OH$)、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟乙基、二氟乙基、三氟乙基、四氟乙基、五

氟乙基、 $-(CH_2)_2-S-C_2H_5$ 、 $-(CH_2)_2-SO_2-C_2H_5$ 或 ；

[0173] R^{2a} 为氢、氰基、氨基羰基 ($CONH_2$)、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟乙基、二氟乙基、三氟乙基、四氟乙基、五氟乙基、三氟甲氧基、二氟氯甲氧基、二氯氟甲氧基、三氟甲硫基、三氟甲基磺酰基、三氟甲基亚磺酰基、氟或氯；

[0174] R^{2b} 为氢、甲氧基、乙氧基、三氟甲基、甲基羰基氨基 ($NHCO-$ 甲基)、氟或氯；

[0175] R^3 为氟、氯、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟乙基、二氟乙基、三氟乙基、四氟乙基、五氟乙基、三氟甲氧基、二氟氯甲氧基、二氯氟甲氧基、三氟甲硫基、三氟甲基磺酰基、三氟甲基亚磺酰基；或为苯基、吡啶-1-基或咪唑-1-基，其各自任选地被三氟甲基单取代；

[0176] R^4 为氢、氟、氯、溴或氰基；

[0177] R^5 为甲基、乙基、异丙基、甲氧基甲基或甲氧基乙基；

[0178] n 为 0、1 或 2。

[0179] 强调 (构型 5) 的是式 (I) 的化合物，其中

[0180] A^1 为氮 (N) 或 $=C-H$ ；


[0181] A^2 为 $-N-CH_3$ 或氧 (O)；

[0182] A^3 为氧 (O)；

[0183] A^4 为氮 (N) 或 $=C-H$ ；

[0184] A^5 为 $=C-H$ ；


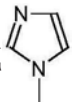
[0185] R^1 为甲基、乙基、正丙基、异丙基、环丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、环丁基、羟基乙基 ($-CH_2-CH_2-OH$)、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟乙基、二氟乙基、三氟乙基、四氟乙基、五

氟乙基、 $-(CH_2)_2-S-C_2H_5$ 、 $-(CH_2)_2-SO_2-C_2H_5$ 或  (氧杂环丁烷-3-基)；

[0186] R^{2a} 为氢、氰基、氨基羰基 ($CONH_2$)、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟乙基、二氟乙基、三氟乙基、四氟乙基、五氟乙基、三氟甲氧基、三氟甲硫基、三氟甲基磺酰基、三氟甲基亚磺酰基、氟或氯；

[0187] R^{2b} 为氢、甲氧基、乙氧基、三氟甲基、甲基羰基氨基 ($NHCO-$ 甲基)、氟或氯；

[0188] R^3 为氟、氯、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟乙基、二氟乙基、三氟乙基、四氟乙基、

五氟乙基、三氟甲氧基、三氟甲硫基、三氟甲基磺酰基、三氟甲基亚磺酰基；或为苯基、 (吡唑-1-基) 或  (咪唑-1-基)，其各自任选地被三氟甲基单取代；

[0189] n 为 0、1 或 2。

[0190] 特别强调 (构型 6) 的是式 (I) 的化合物, 其中

[0191] A^1 为氮 (N) 或 $=C-H$;

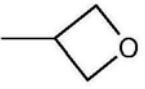
[0192] A^2 为 $-N-CH_3$ 或氧 (O);

[0193] A^3 为氧;

[0194] A^4 为氮 (N) 或 $=C-H$;

[0195] A^5 为 $=C-H$;

[0196] R^1 为甲基、乙基、正丙基、异丙基、三氟甲基、 $-CH_2-CH_2-F$ 、 $-CH_2-CH_2-OH$ 、 $-(CH_2)_2-S-C_2$

H_5 、 $-(CH_2)_2-SO_2-C_2H_5$ 或  ;

[0197] R^{2a} 为氢、三氟甲基、氰基、 $CONH_2$ 、氟或氯;

[0198] R^{2b} 为氢、氯、三氟甲基、甲氧基或 $NHCOCH_3$;

[0199] R^3 为五氟乙基、三氟甲基、氯、 $4-CF_3(C_6H_4)$ 、 $4-(CF_3)$ 吡唑-1-基、 $3-(CF_3)$ 吡唑-1-基或 $4-(CF_3)$ 咪唑-1-基;

[0200] n 为 0、1 或 2。

[0201] 在另一优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 和 n 各自如上文定义, 尤其是如在构型 (1) 或构型 (2) 或构型 (3) 或构型 (4) 或构型 (5) 或构型 (6) 中的定义, 且

[0202] R^{2b} 为乙酰基、氨基、SCN、三 $-(C_1-C_6)$ 烷基甲硅烷基、 (C_3-C_8) 环烷基、 (C_3-C_8) 环烷基 $-(C_3-C_8)$ 环烷基、 (C_1-C_6) 烷基 $-(C_3-C_8)$ 环烷基 (经由被烷基取代的环烷基键合)、卤代 (C_3-C_8) 环烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 卤代烯基、 (C_2-C_6) 氰基烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_2-C_6) 卤代炔基、 (C_2-C_6) 氰基炔基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 卤代烷氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基 $-(C_1-C_6)$ 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基 $-(C_1-C_6)$ 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷基羟基亚氨基、 (C_1-C_6) 烷氧基亚氨基、 (C_1-C_6) 烷基 $-(C_1-C_6)$ 烷氧基亚氨基、 (C_1-C_6) 卤代烷基 $-(C_1-C_6)$ 烷氧基亚氨基、 (C_1-C_6) 烷硫基、 (C_1-C_6) 卤代烷硫基、 (C_1-C_6) 烷氧基 $-(C_1-C_6)$ 烷硫基、 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) 卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) 烷氧基 $-(C_1-C_6)$ 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基、 (C_1-C_6) 卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_6) 烷氧基 $-(C_1-C_6)$ 烷基磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基氧基、 (C_1-C_6) 烷基羰基、 (C_1-C_6) 烷硫基羰基、 (C_1-C_6) 卤代烷基羰基、 (C_1-C_6) 烷基羰基氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基、 (C_1-C_6) 卤代烷氧基羰基、氨基羰基、 (C_1-C_6) 烷基氨基羰基、 (C_1-C_6) 烷基氨基硫代羰基、二 $-(C_1-C_6)$ 烷基氨基羰基、二 $-(C_1-C_6)$ 烷基氨基硫代羰基、 (C_2-C_6) 烯基氨基羰基、二 $-(C_2-C_6)$ 烯基氨基羰基、 (C_3-C_8) 环烷基氨基羰基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基氨基、 (C_1-C_6) 烷基氨基、二 (C_1-C_6) 烷基氨基、氨基磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基氨基磺酰基、二 (C_1-C_6) 烷基氨基磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基硫代脒基、氨基硫代羰基、 (C_1-C_6) 烷基氨基硫代羰基、二 (C_1-C_6) 烷基氨基硫代羰基、 (C_3-C_8) 环烷基氨基、 $NHCO-(C_1-C_6)$ 烷基 $-(C_1-C_6)$ 烷基羰基氨基),

[0203] 为在每种情况下任选地相同或不同地被单或多取代的杂芳基, 其中可任选地存在至少一个羰基基团和 / 或其中在每种情况下可能的取代基如下: 氰基、羧基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三 $-(C_1-C_6)$ 烷基甲硅烷基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 卤代烷基、 (C_1-C_6) 氰基烷基、 (C_1-C_6) 羟烷基、羟基羰基 $-(C_1-C_6)$ 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基 $-(C_1-C_6)$ 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基 $-(C_1-C_6)$ 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 卤代烯基、 (C_2-C_6) 氰基烯基、 (C_2-C_6)

炔基、(C₂-C₆) 卤代炔基、(C₂-C₆) 氰基炔基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 氰基烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 卤代烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 卤代烷硫基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷硫基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、二(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、二(C₂-C₆)-烯基氨基羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆) 烷基氨基、二(C₁-C₆) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、二(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基硫代脒基、氨基硫代脒基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代脒基、二(C₁-C₆) 烷基氨基硫代脒基、(C₃-C₈) 环烷基氨基；

[0204] 在另一优选的实施方案中，本发明涉及式 (I) 的化合物，其中 R¹、R^{2a}、R³、A¹、A²、A³、A⁴、A⁵和 n 各自如上文定义，尤其如在构型 (1) 或构型 (2) 或构型 (3) 或构型 (4) 或构型 (5) 或构型 (6) 中的定义，且

[0205] R^{2b}为乙酰基、氨基、SCN、三-(C₁-C₄) 烷基甲硅烷基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₃-C₆) 环烷基-(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷基-(C₃-C₆) 环烷基（经由烷基取代的环烷基来键合）、卤代(C₃-C₆) 环烷基、(C₂-C₄) 烯基、(C₂-C₄) 卤代烯基、(C₂-C₄) 氰基烯基、(C₂-C₄) 炔基、(C₂-C₄) 卤代炔基、(C₂-C₄) 氰基炔基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 卤代烷氧基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷基-(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 卤代烷基-(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷硫基、(C₁-C₄) 卤代烷硫基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₄) 烷基羰基、(C₁-C₄) 卤代烷基羰基、氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、二(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₄) 烷基氨基、二(C₁-C₄) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、二(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、氨基硫代脒基、NHCO-(C₁-C₄) 烷基((C₁-C₄) 烷基羰基氨基)，

[0206] 为在每种情况下相同或不同地单或二取代的杂芳基，其中可任选地存在至少一个羰基基团和/或其中在每种情况下可能的取代基如下：氰基、卤素、硝基、乙酰基、氨基、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 氰基烷基、(C₁-C₄) 羟烷基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 烯基、(C₂-C₄) 卤代烯基、(C₂-C₄) 氰基烯基、(C₂-C₄) 炔基、(C₂-C₄) 卤代炔基、(C₂-C₄) 氰基炔基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 卤代烷氧基、(C₁-C₄) 氰基烷氧基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷基-(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 卤代烷基-(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷硫基、(C₁-C₄) 卤代烷硫基、(C₁-C₄) 烷硫基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₄) 烷基羰基、(C₁-C₄) 卤代烷基羰基、氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、二(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₄) 烷基氨基、二(C₁-C₄) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、二(C₁-C₄) 烷基氨基

磺酰基。

[0207] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中 R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 和 n 各自如上文定义,尤其如在构型 (1) 或构型 (2) 或构型 (3) 或构型 (4) 或构型 (5) 或构型 (6) 中的定义,且

[0208] R^{2b} 为 (C_1-C_4) 烷氧基或 $NHCO-(C_1-C_4)$ 烷基。

[0209] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中 R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 和 n 各自如上文定义,尤其如在构型 (1) 或构型 (2) 或构型 (3) 或构型 (4) 或构型 (5) 或构型 (6) 中的定义,且

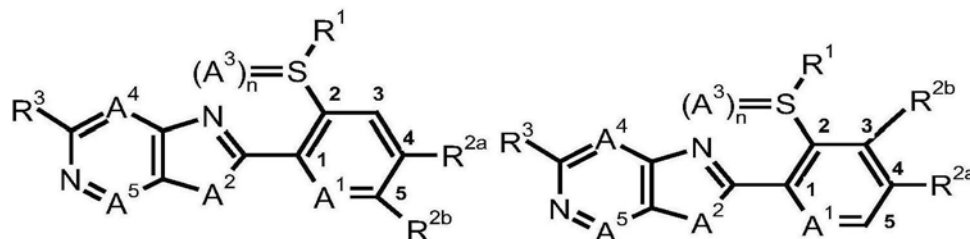
[0210] R^{2b} 为甲氧基、乙氧基或 $NHCO-$ 甲基。

[0211] 在另一优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中 R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 和 n 各自如上文定义,尤其如在构型 (1) 或构型 (2) 或构型 (3) 或构型 (4) 或构型 (5) 或构型 (6) 中的定义,以及

[0212] R^{2b} 为甲氧基或 $NHCO-$ 甲基。

[0213] R^{2b} 连接在 3 位或 5 位:

[0214]



[0215] 在优选的定义中,除非另有说明,

[0216] 卤素选自氟、氯、溴和碘,依次优选选自氟、氯和溴;

[0217] 芳基(包括作为更大单元,例如芳基烷基的部分)选自苯基、萘基、蒽基、菲基,以及相应地优选苯基;

[0218] 杂芳基(hetaryl)(与杂芳基(heteroaryl)同义,包括作为更大单元,例如杂芳基烷基的部分)选自呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡啶基、咪唑基、三唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、1,2,3-噁二唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,5-噁二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,2,5-噻二唑基、四唑基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、1,2,3-三嗪基、1,2,4-三嗪基、1,3,5-三嗪基、苯并呋喃基、苯并异呋喃基、苯并噻吩基、苯并异噻吩基、吲哚基、异吲哚基、吲唑基、苯并噻唑基、苯并异噻唑基、苯并噁唑基、苯并异噁唑基、苯并咪唑基、2,1,3-苯并噁二唑、喹啉基、异喹啉基、噌啉基、酞嗪基、喹啉基、喹喔啉基、茶啉基、苯并三嗪基、嘌呤基、蝶啶基和吡嗪基;

[0219] 杂环基为含有1或2个氮原子和/或一个氧原子和/或一个硫原子的饱和的4元环、5元环或6元环,例如氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、氧杂环丁烷基、四氢呋喃基、四氢吡喃基、二噁烷基、硫杂环丁烷基、四氢噻吩基、四氢噻喃基、哌嗪基、吗啉基和硫代吗啉基。

[0220] 在特别优选的定义中,除非另有说明,

[0221] 卤素选自氟、氯、溴和碘,依次优选选自氟、氯和溴;

[0222] 芳基(包括更大单元,例如芳基烷基的部分)选自苯基、萘基、蒽基、菲基,以及相

应地优选苯基；

[0223] 杂芳基（包括更大单元，例如杂芳基烷基的部分）选自吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、哒嗪基、吡唑基、咪唑基、三唑基、噻唑基和四唑基。

[0224] 杂环基选自氧杂环丁烷基、四氢呋喃基和哌嗪基。

[0225] 在本发明的上下文中，除非另有定义，术语“烷基”，无论其自身还是与其他术语结合（例如卤代烷基），都应当理解为意指具有 1 至 12 个碳原子的饱和脂肪烃基的基团，并且其可为支化的或未支化的。C₁-C₁₂- 烷基的实例为甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、正戊基、异戊基、新戊基、叔戊基、1- 甲基丁基、2- 甲基丁基、1- 乙基丙基、1, 2- 二甲基丙基、己基、正庚基、正辛基、正壬基、正癸基、正十一烷基和正十二烷基。在这些烷基中，特别优选 C₁-C₆- 烷基。尤其优选 C₁-C₄- 烷基。

[0226] 根据本发明，除非另外定义，术语“烯基”，无论其自身还是与其他术语结合，都应当理解为意指具有至少一个双键的直链或支链的 C₂-C₁₂- 烯基，例如乙烯基、烯丙基、1- 丙烯基、异丙烯基、1- 丁烯基、2- 丁烯基、3- 丁烯基、1, 3- 丁二烯基、1- 戊烯基、2- 戊烯基、3- 戊烯基、4- 戊烯基、1, 3- 戊二烯基、1- 己烯基、2- 己烯基、3- 己烯基、4- 己烯基、5- 己烯基和 1, 4- 己二烯基。在这些基团中，优选 C₂-C₆- 烯基且特别优选 C₂-C₄- 烯基。

[0227] 根据本发明，除非另外定义，术语“炔基”，无论其自身还是与其他术语结合，都应当理解为意指具有至少一个三键的直链或支链的 C₂-C₁₂- 炔基，例如乙炔基、1- 丙炔基和炔丙基。在这些基团中，优选 C₃-C₆- 炔基以及特别优选 C₃-C₄- 炔基。炔基基团还可含有至少一个双键。

[0228] 根据本发明，除非另外定义，术语“环烷基”，无论其自身还是与其他术语结合，都应当理解为意指 C₃-C₈- 环烷基，例如环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基和环辛基。在这些基团中，优选 C₃-C₆- 环烷基。

[0229] 术语“烷氧基”，无论其自身还是与其他术语结合，例如卤代烷氧基，都应当理解为意指 O- 烷基基团，其中术语“烷基”如上文定义。

[0230] 卤素取代的基团如卤代烷基为单卤代或多卤代的，最高达可能取代基的最大值。在多卤代的情况下，卤素原子可相同或不同。在这种情况下，卤素为氟、氯、溴或碘，尤其是氟、氯或溴。

[0231] 除非另有说明，任选地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，所述取代基可相同或不同。

[0232] 上文以宽泛地或在优选范围内给出的基团定义或说明应用在最终产物以及相应的原材料和中间体上。这些基团定义可彼此随意地结合，即包括各自优选范围之间的结合。

[0233] 根据本发明优选使用式 (I) 的化合物，其中存在上文所列的优选定义的结合。

[0234] 根据本发明特别优选使用式 (I) 的化合物，其中存在上文所列的特别优选的定义的结合。

[0235] 根据本发明非常特别优选使用式 (I) 的化合物，其中存在上文所列的非常特别优选的定义的结合。

[0236] 根据本发明重点使用式 (I) 的化合物，其中存在上文所列的具体定义的结合。

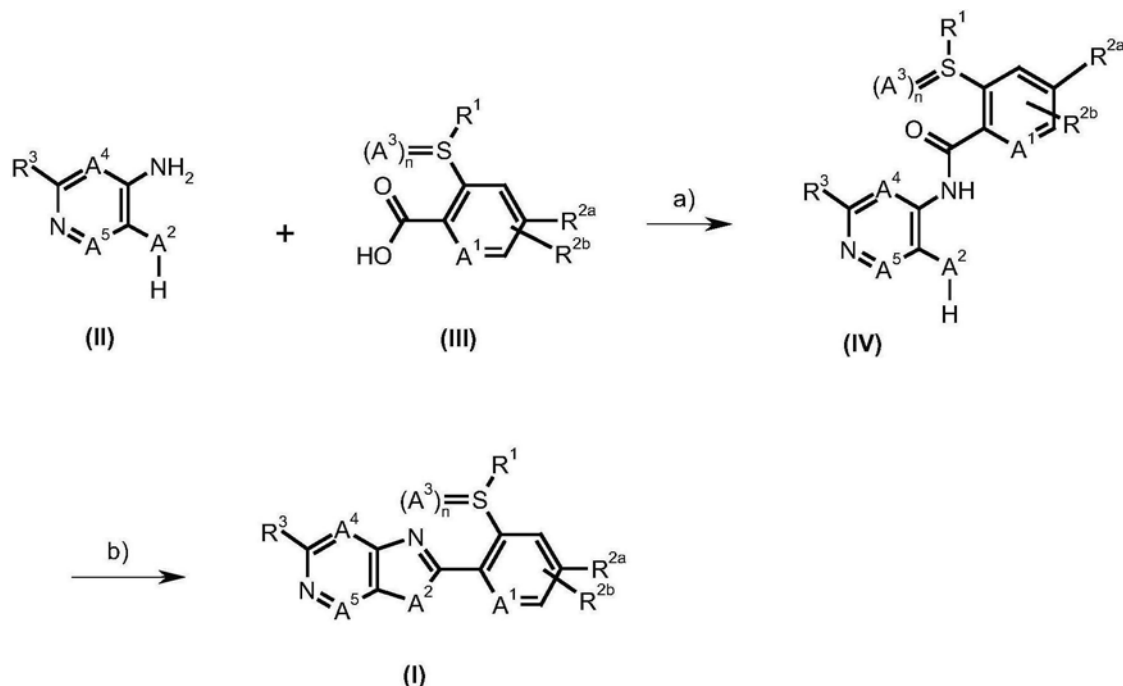
[0237] 根据本发明特别强调使用式 (I) 的化合物，其中存在上文所列的非常具体的定义的结合。

[0238] 根据取代基的性质,在不同的组合物中,式(I)的化合物可为几何异构体和/或旋光异构体或相应异构体的混合物。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。因此本发明包括纯立体异构体和这些异构体的任何所需的混合物。

[0239] 本发明的式(I)的化合物可通过下列方案中所示的方法来获得:

[0240] 方法A

[0241]



[0242] R¹、R^{2a}、R^{2b}、R³、A¹、A²、A³、A⁴、A⁵和 n 基团各自如上文定义。

[0243] 步骤 a)

[0244] 式(IV)的化合物可通过类似于在 US5576335 中记载的方法在缩合剂的存在下通过式(II)的化合物与式(III)的羧酸反应来制备。

[0245] 式(II)的化合物可为市售的或可通过已知的方法,例如类似于在 US2003/69257 或 W02006/65703 中记载的方法来制备。

[0246] 式(III)的羧酸可为市售的或可通过已知的方法,例如类似于在 US2010/234604、W02012/61926 或 Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 18(2008), 5023-5026 中记载的方法来制备。

[0247] 式(II)的化合物与式(III)的羧酸的反应可以不用溶剂或在溶剂中进行,优选选自在主要反应条件下为惰性的常规溶剂的溶剂中进行该反应。优选醚类,例如二异丙醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷;卤代烃,例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯;腈类,例如乙腈或丙腈;芳族烃,例如甲苯或二甲苯;非质子极性溶剂,例如 N,N-二甲基甲酰胺或 N-甲基吡咯烷酮;或含氮化合物,例如吡啶。

[0248] 合适的缩合剂为,例如,碳二亚胺例如 1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳二亚胺盐酸盐(EDCI)或 1,3-二环己基碳二亚胺。

[0249] 该反应可在减压、标准压力或在高压下且在 0 至 180℃ 的温度下进行,优选在标准压力和 20 至 140℃ 的温度下进行该反应。

[0250] 步骤 b)

[0251] 式 (I) 的化合物可通过缩合式 (IV) 的化合物, 例如类似于在 W02012/86848 中记载的方法来制备。

[0252] 式 (I) 化合物的转化可以不在溶剂中或在溶剂中进行, 优选选自在主要反应条件下为惰性的常规溶剂的溶剂中进行该反应。优选醚类, 例如二异丙醚、二噁烷、四氢呋喃、1, 2-二甲氧基乙烷、叔丁基甲醚; 卤代烃, 例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1, 2-二氯乙烷或氯苯; 腈类, 例如乙腈或丙腈; 芳族烃, 例如甲苯或二甲苯; 非质子极性溶剂, 例如 N, N-二甲基甲酰胺或 N-甲基吡咯烷酮; 或含氮化合物, 例如吡啶。

[0253] 该反应可在缩合剂、酸、碱或氯化剂的存在下进行。

[0254] 合适的缩合剂的实例为碳二亚胺, 例如 1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳二亚胺盐酸盐 (EDCI) 或 1, 3-二环己基碳二亚胺; 酸酐, 例如乙酸酐、三氟乙酸酐; 三苯基膦、碱和四氯化碳的混合物或三苯基膦和偶氮二酯例如偶氮二甲酸二乙酯的混合物。

[0255] 可用于所述反应的合适的酸的实例为磺酸, 例如对甲苯磺酸; 羧酸, 如乙酸; 或多磷酸。

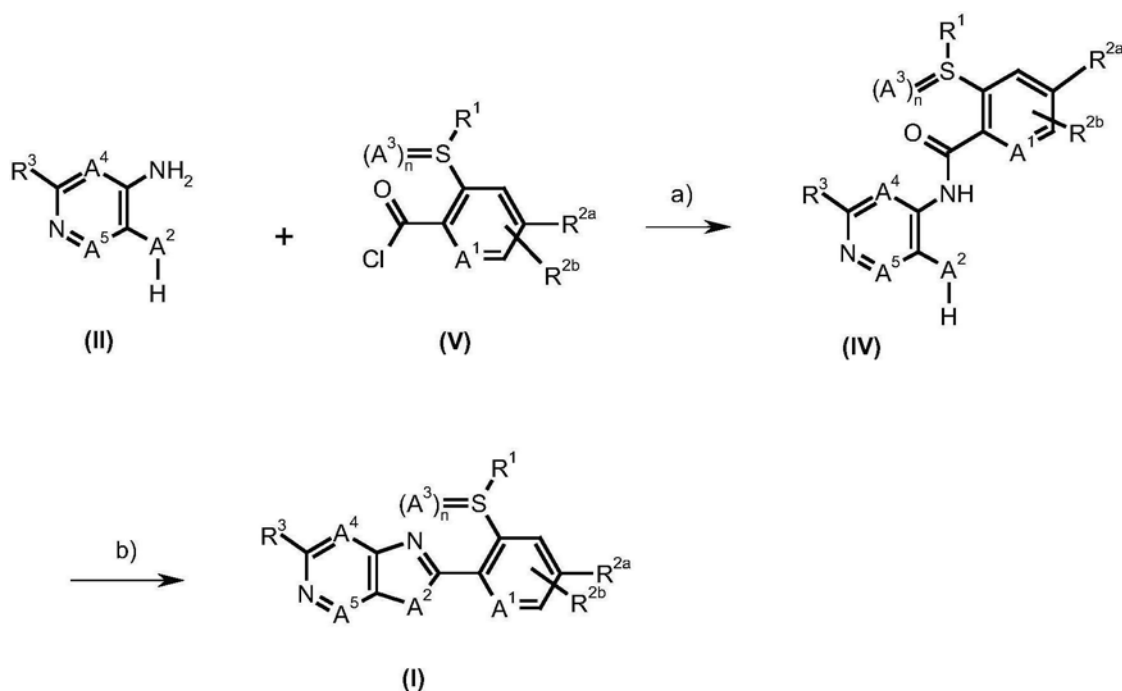
[0256] 合适的碱的实例为含氮杂环, 例如吡啶、甲基吡啶、2, 6-二甲基吡啶、1, 8-二氮杂双环 [5. 4. 0]-7-十一碳烯 (DBU); 叔胺例如三乙胺和 N, N-二异丙基乙胺; 无机碱例如磷酸钾、碳酸钾和氢化钠。

[0257] 合适的氯化剂的实例为氧氯化磷 (phosphorus oxychloride)。

[0258] 该反应可在减压、标准压力或高压下且在 0 至 200°C 的温度下进行。

[0259] 方法 B

[0260]



[0261] R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 和 n 基团各自如上文定义。

[0262] 步骤 a)

[0263] 在本发明的另一实施方案中, 式 (IV) 的化合物可在缩合剂的存在下通过式 (II) 的化合物与式 (V) 的碳酰氯的反应来制备。

[0264] 式 (V) 的碳酰氯可为市售的或可通过已知的方法, 例如类似于在 US2010/234603

或 US2010/234604 中记载的方法来制备。

[0265] 式 (II) 的化合物与式 (V) 的碳酰氯的反应可以不在溶剂中或在溶剂中进行, 优选选自在主要反应条件下为惰性的常规溶剂的溶剂中进行该反应。优选醚类, 例如二异丙醚、二噁烷、四氢呋喃、1, 2- 二甲氧基乙烷; 卤代烃, 例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1, 2- 二氯乙烷或氯苯; 脂族烃, 例如己烷、庚烷或辛烷; 芳族烃, 例如甲苯或二甲苯; 腈类, 例如乙腈或丙腈; 非质子极性溶剂, 例如 N, N- 二甲基甲酰胺或 N- 甲基吡咯烷酮; 或含氮化合物, 例如吡啶。

[0266] 该反应优选在碱的存在下进行。合适的碱为通常用于这种反应的无机碱。优选使用的碱例如选自碱金属或碱土金属的乙酸盐、磷酸盐、碳酸盐和碳酸氢盐。特别优选乙酸钠、磷酸钠、磷酸钾、碳酸铯、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠、碳酸氢钾。进一步合适的碱为叔胺, 例如三乙胺和 N, N- 二异丙基乙胺; 以及含氮杂环, 例如吡啶、甲基吡啶、2, 6- 二甲基吡啶、4- 二甲基氨基吡啶和 1, 8- 二氮杂双环 [5. 4. 0]-7- 十一碳烯 (DBU)。

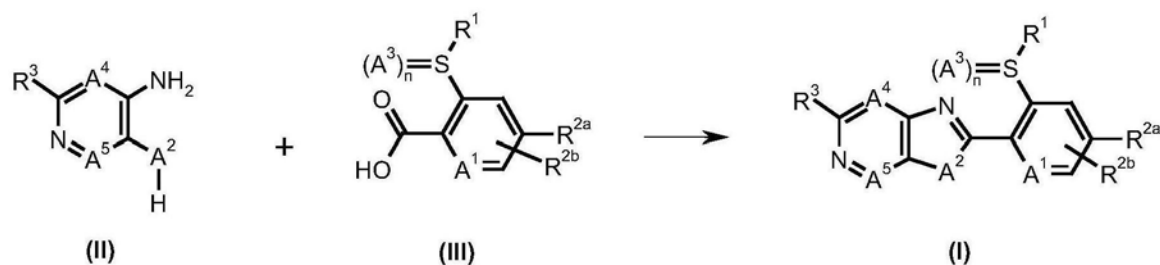
[0267] 该反应可在减压、标准压力或高压下且在 -20℃ 至 100℃ 的温度下进行, 优选在标准压力和 0℃ 至 80℃ 下进行该反应。

[0268] 步骤 b)

[0269] 式 (IV) 的化合物向式 (I) 化合物的进一步转化如在方法 A), 步骤 b) 中进行。

[0270] 方法 C

[0271]



[0272] R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 和 n 基团各自如上文定义。

[0273] 在本发明的另一实施方案中, 式 (I) 的化合物可在缩合剂的存在下由式 (II) 和 (III) 的中间体化合物以一步法来制备。

[0274] 式 (I) 化合物的转化可以不在溶剂中或在溶剂中进行, 优选选自在主要反应条件下为惰性的常规溶剂的溶剂中进行该反应。优选醚类, 例如二异丙醚、二噁烷、四氢呋喃、1, 2- 二甲氧基乙烷、叔丁基甲醚; 卤代烃, 例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1, 2- 二氯乙烷或氯苯; 醇类, 例如甲醇、乙醇或异丙醇; 腈类, 例如乙腈或丙腈; 芳族烃, 例如甲苯或二甲苯; 非质子极性溶剂, 例如 N, N- 二甲基甲酰胺或 N- 甲基吡咯烷酮; 或含氮化合物, 例如吡啶。

[0275] 合适的缩合剂的实例为碳二亚胺, 例如 1-(3- 二甲基氨基丙基)-3- 乙基碳二亚胺盐酸盐 (EDCI) 或 1, 3- 二环己基碳二亚胺; 酸酐, 例如乙酸酐、三氟乙酸酐; 三苯基磷、碱和四氯化碳的混合物或三苯基磷和偶氮二甲酸二乙酯的混合物。

[0276] 该反应可在酸或碱的存在下进行。

[0277] 可用于所述反应的酸的实例为磺酸, 例如甲磺酸或对甲苯磺酸; 羧酸, 如乙酸; 或多磷酸。

[0278] 合适的碱的实例为含氮杂环, 例如吡啶、甲基吡啶、2, 6- 二甲基吡啶、1, 8- 二氮杂

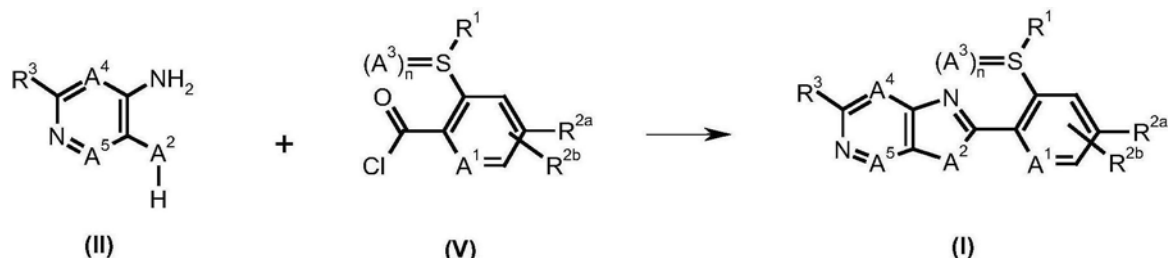
双环 [5.4.0]-7-十一碳烯 (DBU);叔胺,例如三乙胺和 N,N-二异丙基乙胺;无机碱,例如磷酸钾、碳酸钾和氢化钠。

[0279] 该反应可在合适的催化剂,例如 1-羟基苯并三唑的存在下进行。

[0280] 该反应可在减压、标准压力或高压下且在 0 至 200℃ 的温度下进行。

[0281] 方法 D

[0282]



[0283] R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 和 n 基团各自如上文定义。

[0284] 在本发明的另一实施方案中,式 (I) 的化合物可由式 (II) 和 (V) 的中间体化合物以一步法来制备。

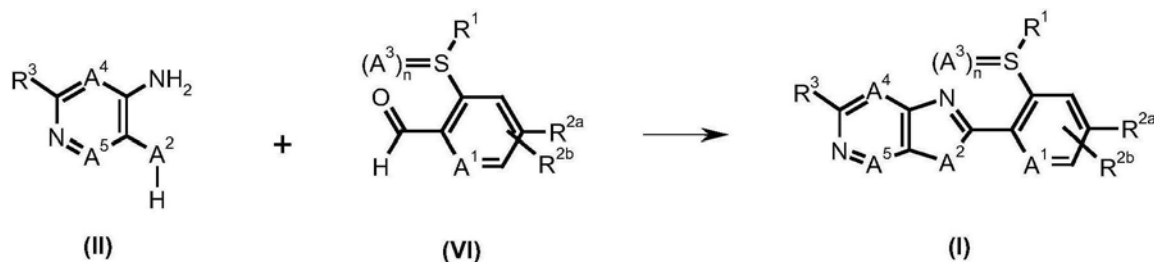
[0285] 式 (I) 化合物的转化可以不在溶剂中或在溶剂中进行,优选选自在主要反应条件下为惰性的常规溶剂的溶剂中进行该反应。优选醚类,例如二异丙醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、叔丁基甲醚;卤代烃,例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯;醇类,例如甲醇、乙醇或异丙醇;腈类,例如乙腈或丙腈;芳族烃,例如甲苯或二甲苯;非质子极性溶剂,例如 N,N-二甲基甲酰胺或 N-甲基吡咯烷酮;或含氮化合物,例如吡啶。

[0286] 该反应优选在碱的存在下进行。合适的碱为通常用于这种反应的无机碱。优选使用的碱例如选自碱金属或碱土金属的乙酸盐、磷酸盐、氢氧化物、碳酸盐和碳酸氢盐。优选碳酸铯、碳酸钠、碳酸钾、氢氧化钠和氢氧化钾。更合适的碱为叔胺,例如三乙胺和 N,N-二异丙基乙胺;以及含氮杂环,例如吡啶、甲基吡啶、2,6-二甲基吡啶、4-二甲基氨基吡啶和 1,8-二氮杂双环 [5.4.0]-7-十一碳烯 (DBU)。

[0287] 该反应可在减压、标准压力或高压下且在 0℃ 至 200℃ 的温度下进行。

[0288] 方法 E

[0289]



[0290] R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 和 n 基团各自如上文定义。

[0291] 在本发明的另一实施方案中,式 (I) 的化合物可在氧化剂的存在下由式 (II) 的化合物和式 (VI) 的醛类来制备。

[0292] 式 (VI) 的醛类可为市售的或可通过已知方法,例如类似于在 US2009/192195、US2010/227894 或 Angewandte Chemie, International Edition, 48(2009), 7064-7068 中记载的方法来制备。

[0293] 式 (I) 化合物的转化可以不在溶剂中或在溶剂中进行, 优选在溶剂中进行该反应。优选醚类, 例如二异丙醚、二噁烷、四氢呋喃、1, 2-二甲氧基乙烷、叔丁基甲醚; 卤代烃, 例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1, 2-二氯乙烷或氯苯; 醇类, 例如甲醇、乙醇或异丙醇; 酯类, 例如乙酸乙酯; 腈类, 例如乙腈或丙腈; 芳族烃, 例如甲苯或二甲苯; 非质子极性溶剂, 例如 N, N-二甲基甲酰胺或 N-甲基吡咯烷酮; 或含氮化合物, 例如吡啶。

[0294] 该反应可在酸的存在下进行。可用于该反应的酸的实例为磺酸, 例如甲磺酸或对甲苯磺酸; 羧酸类, 例如乙酸; 或多磷酸。

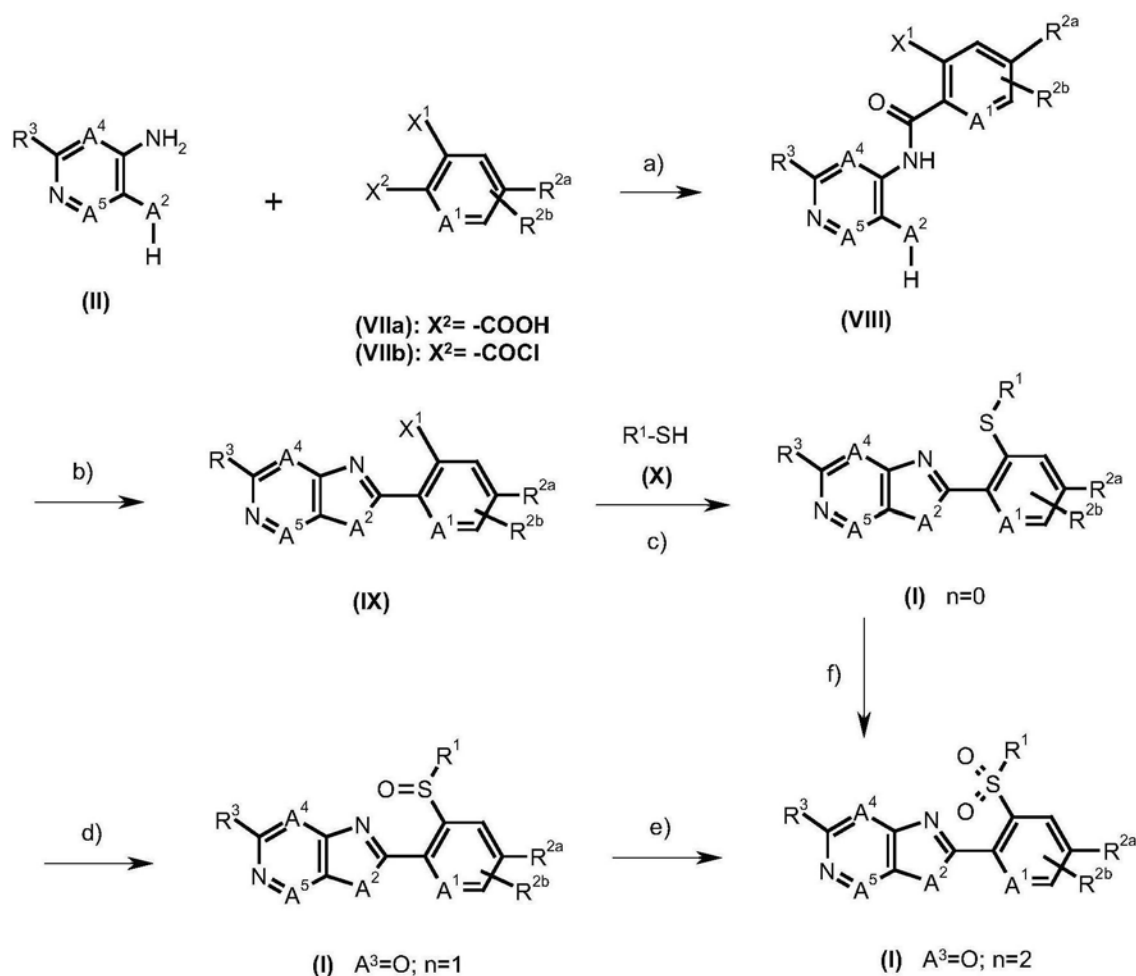
[0295] 该反应还可在亚硫酸盐存在下进行。可用于所述反应的亚硫酸盐的实例为亚硫酸氢钠和亚硫酸钠。

[0296] 可用于所述反应的氧化剂的实例为氧气、氯化亚铜 (II) 或 DDQ。

[0297] 该反应可在减压、标准压力或高压下且在 0°C 至 200°C 的温度下进行, 优选在标准压力和 20 至 150°C 的温度下进行该反应。

[0298] 方法 F

[0299]



[0300] R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 和 n 基团各自如上文定义。

[0301] 步骤 a)

[0302] 式 (VIII) 的化合物可以类似于在 US5576335 中记载的方法在缩合剂或碱存在下通过式 (II) 的化合物与式 (VIIa) 的羧酸或与式 (VIIb) 的碳酰氯的反应来制备。

[0303] 式 (II) 的化合物可为市售的或可通过已知的方法, 例如类似于在 US2003/69257

或 W02006/65703 中记载的方法来制备。

[0304] 式 (VIIa) 的羧酸可为市售的或可通过已知的方法, 例如类似于在 US2010/234604、W02012/61926 或 Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 18(2008), 5023-5026 中记载的方法来制备。

[0305] 式 (VIIb) 的碳酰氯可为市售的或可通过已知的方法, 例如类似于在 US2010/234603 或 US2010/234604 中记载的方法来制备。

[0306] 式 (II) 的化合物与式 (VIIa) 的羧酸或与式 (VIIb) 的碳酰氯的反应可以不在溶剂中或在溶剂中进行, 优选选自在主要反应条件下为惰性的常规溶剂的溶剂中进行该反应。优选醚类, 例如二异丙醚、二噁烷、四氢呋喃、1, 2-二甲氧基乙烷; 卤代烃, 例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1, 2-二氯乙烷或氯苯; 腈类, 例如乙腈或丙腈; 芳族烃, 例如甲苯或二甲苯; 非质子极性溶剂, 例如 N, N-二甲基甲酰胺或 N-甲基吡咯烷酮; 或含氮化合物, 例如吡啶。

[0307] 合适的缩合剂为, 例如, 碳二亚胺例如 1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳二亚胺盐酸盐 (EDCI) 或 1, 3-二环己基碳二亚胺。

[0308] 合适的碱为通常用于这种反应的无机碱。优选使用的碱例如选自碱金属或碱土金属的乙酸盐、磷酸盐、碳酸盐和碳酸氢盐。特别优选乙酸钠、磷酸钠、磷酸钾、碳酸铯、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠、碳酸氢钾。

[0309] 该反应可在减压、标准压力或高压下且在 0°C 至 180°C 的温度下进行, 优选在标准压力和 20 至 140°C 的温度下进行该反应。

[0310] 步骤 b)

[0311] 式 (IX) 的化合物可通过缩合式 (VIII) 的中间体化合物, 例如以类似于在 W02012/86848 中记载的方法来制备。

[0312] 式 (IX) 化合物的转化可以不在溶剂中或在溶剂中进行, 优选选自在主要反应条件下为惰性的常规溶剂的溶剂中发生该反应。优选醚类, 例如二异丙醚、二噁烷、四氢呋喃、1, 2-二甲氧基乙烷、叔丁基甲醚; 卤代烃, 例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1, 2-二氯乙烷或氯苯; 腈类, 例如乙腈或丙腈; 芳族烃, 例如甲苯或二甲苯; 非质子极性溶剂, 例如 N, N-二甲基甲酰胺或 N-甲基吡咯烷酮; 或含氮化合物, 例如吡啶。

[0313] 该反应可在缩合剂、酸、碱或氯化剂的存在下进行。

[0314] 合适的缩合剂的实例为碳二亚胺, 例如 1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳二亚胺盐酸盐 (EDCI) 或 1, 3-二环己基碳二亚胺; 酸酐, 例如乙酸酐、三氟乙酸酐; 三苯基膦、碱和四氯化碳的混合物或三苯基膦和偶氮二酯例如偶氮二甲酸二乙酯的混合物。

[0315] 可用于上述反应的合适的酸的实例为磺酸, 例如对甲苯磺酸; 羧酸, 如乙酸; 或多磷酸。

[0316] 合适的碱的实例为含氮杂环, 例如吡啶、甲基吡啶、2, 6-二甲基吡啶、1, 8-二氮杂双环 [5. 4. 0]-7-十一碳烯 (DBU); 叔胺, 例如三乙胺和 N, N-二异丙基乙胺; 无机碱, 例如磷酸钾、碳酸钾和氢化钠。

[0317] 合适的氯化剂的实例为氧氯化磷。

[0318] 该反应可在减压、标准压力或高压下且在 0 至 200°C 的温度下进行。

[0319] 步骤 c)

[0320] n 为 0 的式 (I) 的化合物可在碱存在下通过式 (IX) 的中间体化合物与式 (X) 的中间体化合物反应来制备。

[0321] 式 (X) 的硫醇衍生物, 例如甲硫醇、乙硫醇或异丙硫醇, 可为市售的或可通过已知方法, 例如类似于在 US2006/25633、US2006/111591、US2820062、Chemical Communications, 13(2000), 1163-1164 或 Journal of the American Chemical Society, 44(1922), 第 1329 页中记载的方法来制备。

[0322] n 为 0 的式 (I) 化合物的转化可以不在溶剂中或在溶剂中进行, 优选选自在主要反应条件下为惰性的常规溶剂的溶剂中进行该反应。优选醚类, 例如二异丙醚、二噁烷、四氢呋喃、1, 2-二甲氧基乙烷、叔丁基甲醚; 腈类, 例如乙腈或丙腈; 芳族烃, 例如甲苯或二甲苯; 非质子极性溶剂, 例如 N, N -二甲基甲酰胺、 N -甲基吡咯烷酮或二甲基亚砷。

[0323] 合适的碱为无机碱, 选自碱金属或碱土金属的乙酸盐、磷酸盐和碳酸盐。优选碳酸铯、碳酸钠和碳酸钾。进一步合适的碱为碱金属的氢化物, 例如氢化钠。

[0324] 该反应可在减压、标准压力或高压下且在 0 至 200°C 的温度下进行。

[0325] 在所述反应中, X^1 优选为氟原子或氯原子。

[0326] 步骤 d)

[0327] A^3 为氧且 n 为 1 的式 (I) 的化合物可通过氧化 n 为 0 的式 (I) 的化合物来制备。氧化作用通常在选自主要反应条件下为惰性的常规溶剂的溶剂中进行。优选卤代烃, 例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1, 2-二氯乙烷或氯苯; 醇类, 例如甲醇或乙醇; 甲酸; 乙酸; 丙酸或水。

[0328] 合适的氧化剂的实例为过氧化氢、间氯过氧苯甲酸或高碘酸钠。

[0329] 该反应可在减压、标准压力或高压下且在 -20°C 至 120°C 的温度下进行。

[0330] 步骤 e)

[0331] A^3 为氧且 n 为 2 的式 (I) 的化合物可通过氧化 A^3 为氧且 n 为 1 的式 (I) 的化合物来制备。氧化作用通常在溶剂中进行。优选卤代烃, 例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1, 2-二氯乙烷或氯苯; 醇类, 例如甲醇或乙醇; 甲酸; 乙酸; 丙酸或水。

[0332] 合适的氧化剂的实例为过氧化氢和间氯过氧苯甲酸。

[0333] 该反应可在减压、标准压力或高压下且在 -20°C 至 120°C 的温度下进行。

[0334] 步骤 f)

[0335] A^3 为氧且 n 为 2 的式 (I) 的化合物可通过氧化 n 为 0 的式 (I) 的化合物以一步法来制备。氧化作用通常在溶剂中进行。优选卤代烃, 例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1, 2-二氯乙烷或氯苯; 醇类例如甲醇或乙醇; 甲酸; 乙酸; 丙酸或水。

[0336] 合适的氧化剂的实例为过氧化氢和间氯过氧苯甲酸。

[0337] 该反应可在减压、标准压力或高压下且在 -20°C 至 120°C 的温度下进行。

[0338] 方法 G

[0339] R^3 = 卤素的式 (I) 的化合物可转化为 R^3 为定义中的另一种基团的式 (I) 的其他化合物。

[0340] R^3 为选自定义的芳基或杂芳基的 C-键合的基团的式 (I) 的化合物可例如由 R^3 优选为选自氯或溴的卤素的式 (I) 的化合物通过通常已知的方法 (参见 Chem. Rev. 1995, 95, 2457-2483; Tetrahedron 2002, 58, 9633-9695; Metal-Catalyzed Cross-Coupling

Reactions(编者:A.de Meijere,F.Diederich),第2版,Wiley-VCH,Weinheim,2004)来制备。

[0341] 例如, R^3 优选为氯或溴的化合物可在选自过渡金属盐的合适的催化剂存在下,通过已知的方法(参见 W02010071819)与合适的芳基硼酸或其酯反应来得到 R^3 为选自芳基的基团的式(I)的化合物。优选的耦合催化剂的实例包括钯催化剂,例如[1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁]二氯钯(II)或四(三苯基膦)钯。用于进行该方法的合适的碱性反应助剂优选为钠或钾的碳酸盐。

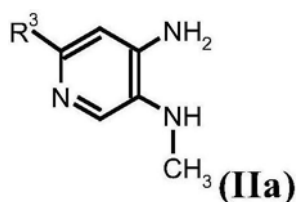
[0342] 所需的一些(杂)芳基硼酸或(杂)芳基硼酸酯是已知的和/或市售的,例如可通过通常已知的方法(参见 Boronic Acids(编者:D.G.Hall),第2版,Wiley-VCH,Weinheim,2011)制备。

[0343] R^3 为 N-键合的杂芳基(例如咪唑-1-基和吡唑-1-基)的式(I)的化合物的制备可由文献中已知的方法(参见,例如 Journal of Organic Chemistry(2010),69,5578),优选在碘化亚铜(I)和碱性反应助剂(例如反式-N,N'-二甲基环己烷-1,2-二胺和碳酸钾)的存在下,在合适的溶剂或稀释剂中进行。有用的溶剂或稀释剂包括所有惰性的有机溶剂,例如脂族烃或芳族烃。优选使用甲苯。

[0344] 一些式(II)的化合物为新的。

[0345] 新的化合物为式(IIa)的那些

[0346]



[0347] 其中 R^3 如上文定义,但是 R^3 不能为氯、溴或 CHO。

[0348] 本发明还提供式(IIa)的化合物,其中 R^3 为 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) 卤代烷硫基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基或 (C_1-C_4) 卤代烷基磺酰基;其中 R^3 不为 CF_3 或 CHF_2 。

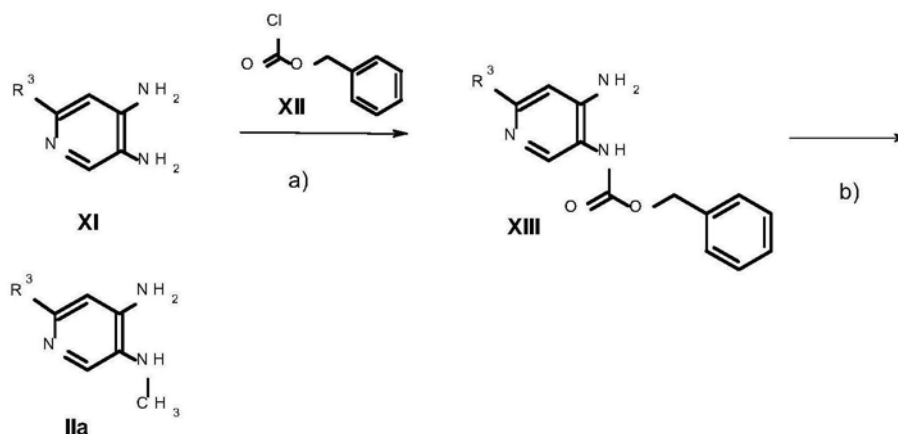
[0349] 优选地, R^3 为 CH_2F 、 C_2H_4F 、 $C_2H_3F_2$ 、 $C_2H_2F_3$ 、 C_2HF_4 、 C_2F_5 、 $n-C_3F_7$ 、 $i-C_3F_7$ 、 OCH_2F 、 SCH_2F 、 $SOCH_2F$ 、 SO_2CH_2F 、 $OCHF_2$ 、 $SCHF_2$ 、 $SOCHF_2$ 、 SO_2CHF_2 、 OCF_3 、 OCF_2Cl 、 $OCFC1_2$ 、 SCF_3 、 $SOCF_3$ 、 SO_2CF_3 、 OC_2H_4F 、 SC_2H_4F 、 SOC_2H_4F 、 $SO_2C_2H_4F$ 、 $OC_2H_3F_2$ 、 $SC_2H_3F_2$ 、 $SOC_2H_3F_2$ 、 $SO_2C_2H_3F_2$ 、 $OC_2H_2F_3$ 、 $SC_2H_2F_3$ 、 $SOC_2H_2F_3$ 、 $SO_2C_2H_2F_3$ 、 OC_2HF_4 、 SC_2HF_4 、 SOC_2HF_4 、 $SO_2C_2HF_4$ 、 OC_2F_5 、 SC_2F_5 、 SOC_2F_5 、 $SO_2C_2F_5$ 、 $n-OC_3F_7$ 、 $n-SC_3F_7$ 、 $n-SOC_3F_7$ 、 $n-SO_2C_3F_7$ 、 $i-OC_3F_7$ 、 $i-SC_3F_7$ 、 $i-SOC_3F_7$ 或 $i-SO_2C_3F_7$ 。

[0350] 更优选地, R^3 为 CH_2F 、 OCF_3 、 C_2H_4F 、 $C_2H_3F_2$ 、 $C_2H_2F_3$ 、 C_2HF_4 、 C_2F_5 、 SCF_3 、 $SOCF_3$ 或 SO_2CF_3 。

[0351] 最优选地, R^3 为 C_2F_5 。

[0352] 方法 H

[0353]



[0354] 其中 R^3 基团如上文定义。

[0355] 步骤 a)

[0356] 式 (XIII) 的化合物可以类似于在 W02005/55928 或 Journal of Medicinal Chemistry, 48(2005), 第 6128-6139 页中记载的方法, 例如在碱存在下通过式 (XI) 的化合物与式 (XII) 的氯碳酸苄酯 (氯甲酸苄酯) 反应来制备。

[0357] 式 (XI) 的化合物可为市售的或可通过已知的方法, 例如类似于在 W02012/3576、W02007/47793 或 W02006/65703 中记载的方法来制备。

[0358] 式 (XIII) 化合物的转化可以不在溶剂中或在溶剂中进行, 优选选自在主要反应条件下为惰性的常规溶剂的溶剂中进行该反应。优选醚类, 例如二异丙醚、二噁烷、四氢呋喃、1, 2-二甲氧基乙烷、叔丁基甲醚; 腈类, 例如乙腈或丙腈; 或芳族烃, 例如甲苯或二甲苯。

[0359] 合适的碱为无机碱, 选自碱金属或碱土金属的乙酸盐、磷酸盐和碳酸盐。优选碳酸铯、碳酸钠和碳酸钾。

[0360] 该反应可在减压、标准压力或高压下且在 0°C 至 120°C 的温度下进行。

[0361] 步骤 b)

[0362] 式 (IIa) 的化合物可通过还原式 (XIII) 的化合物, 例如类似于在 Journal of Heterocyclic Chemistry, 22(1985), 第 313-318 页中记载的方法来制备。

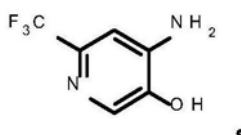
[0363] 合适的还原剂的一个实例为氢化铝锂。

[0364] 式 (IIa) 化合物的转化可以不在溶剂中或在溶剂中进行, 优选选自在主要反应条件下为惰性的常规溶剂中进行该反应。优选醚类, 例如乙醚、二异丙醚、二噁烷、四氢呋喃、1, 2-二甲氧基乙烷或叔丁基甲醚。

[0365] 该反应可在减压、标准压力或高压下且在 0°C 至 100°C 的温度下进行。

[0366] 同样新的化合物为式 (II-02) 的化合物

[0367]



[0368] 方法和用途

[0369] 本发明还涉及用于防治动物害虫的方法, 其中式 (I) 的化合物可以作用于动物害虫和 / 或其生境。动物害虫的防治优选在农业和林业以及材料保护中进行。优选从该方法

中排除的是用于人体或动物体的外科手术或治疗方法以及在人体或动物体上实施的诊断方法。

[0370] 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。

[0371] 在本申请的上下文中,在每种情况下的术语“农药”还总是包含术语“作物保护剂”。

[0372] 具有良好的植物耐受性、有利的恒温动物毒性和良好的环境相容性的式 (I) 的化合物适于下述用途:保护植物和植物器官抵抗生物和非生物胁迫因素、提高采收产率、提高采收材料的质量,以及防治在农业、园艺、家畜饲养、水产养殖、林业、园林和休闲设施、储存产品和材料的保护以及卫生领域中遇到的动物害虫,尤其是昆虫、蛛形纲、蠕虫、线虫和软体动物。这些化合物优选用作农药。它们能有效抵抗通常敏感和抗性物种,而且能抵抗所有或部分发育阶段。上述害虫包括:

[0373] 来自节肢动物门 (Arthropoda)、尤其是来自蛛形纲 ((Arachnida)) 的害虫,例如粉螨属种 (例如粗脚粉螨 (*Acarus siro*))、枸杞瘤瘿螨 (*Aceria kuko*)、柑橘瘤瘿螨 (*Aceria sheldoni*)、刺皮节蜱属种 (*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*))、蛱苔螨 (*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.) (例如梨叶肿瘿螨 (*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*)、樟小爪螨 (*Oligonychus punicae*)、*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*)、*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 turkestani*)、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*) ;

[0374] 来自唇足纲 (*Chilopoda*) 的害虫,例如,地蜈蚣属种 (*Geophilus* spp.)、蚰蜒属种 (*Scutigera* spp.) ;

[0375] 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*) ;

[0376] 来自倍足纲 (*Diplopoda*) 的害虫,例如,千足虫 (*Blaniulus guttulatus*) ;

[0377] 来自昆虫纲的害虫,例如来自蜚蠊目 (*Blattodea*),如东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*)、亚洲蜚蠊 (*Blattella asahinai*)、德国小蠊 (*Blattella germanica*)、马德拉蜚蠊 (*Leucophaea maderae*)、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*))、棕带蜚蠊 (*Supella longipalpa*) ;

[0378] 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.)、杨树萤叶甲 (*Agelastica alni*)、叩甲属种 (*Agriotes* spp.) (例如直条叩头虫 (*Agriotes linneatus*)、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 (*Anthonomus* spp.) (例如棉铃象甲 (*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.) (例如白菜龟象 (*Ceutorrhynchus assimilis*)、油菜茎象甲 (*Ceutorrhynchus quadridens*)、芜菁象甲 (*Ceutorrhynchus rapae*))、跳甲属种 (*Chaetocnema* spp.) (例如甘薯跳甲 (*Chaetocnema confinis*)、玉米齿叶甲 (*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*))、新西兰草地蛴螬 (*Costelytra zealandica*)、叩甲属种 (*Ctenicera* spp.)、象虫属种 (*Curculio* spp.) (例如美核桃象 (*Curculio caryae*)、*Curculio caryatrypes*、榛子象甲 (*Curculio obtusus*)、*Curculio sayi*)、锈赤扁谷盗 (*Cryptolestes ferrugineus*)、长角扁谷盗 (*Cryptolestes pusillus*)、杨干象隐喙属 (*Cryptorhynchus lapathi*)、芒果果核象甲 (*Cryptorhynchus mangiferae*)、细枝象属种 (*Cylindrocopturus* spp.)、密点细枝象 (*Cylindrocopturus adspersus*)、*Cylindrocopturus furnissi*、皮蠹属 (*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*)、南方十一星瓜叶甲 (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、南方十一星瓜叶甲亚种 (*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*)、西方玉米根叶甲 (*Diabrotica virgifera*)

virgifera)、墨西哥玉米根叶甲 (*Diabrotica virgifera zea*)、蛀野螟属 (*Dichocrocis* spp.)、水稻铁甲 (*Dicladispa armigera*)、*Diloboderus* 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*)、茄子跳甲 (*Epitrix fuscula*)、烟草跳甲 (*Epitrix hirtipennis*)、美国马铃薯跳甲 (*Epitrix subcrinita*)、块茎跳甲 (*Epitrix tuberis*))、钻孔虫属种 (*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*)、毛竹小蠹 (*Hypothenemus pubescens*))、甘蔗大褐齿爪鳃金龟 (*Lachnosterna consanguinea*)、烟草甲 (*Lasioderma serricorne*)、长头谷盗 (*Latheticus oryzae*)、波缘薪甲属种 (*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*)、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.) (例如欧洲鳃金龟 (*Melolontha melolontha*))、*Migdolus* 属种、墨天牛属种 (*Monochamus* spp.)、*Naupactus xanthographus*、隐跗郭公虫属种 (*Necrobia* spp.)、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*))、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*)、菜跳甲属种 (*Phyllotreta* spp.) (例如辣根条跳甲 (*Phyllotreta armoraciae*)、西方黑跳甲 (*Phyllotreta pusilla*)、*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*)、谷象属 (*Sitophilus* spp.) (例如小麦象鼻虫 (*Sitophilus granarius*)、*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.) (例如玉米象鼻虫 (*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.) (例如玉米距步甲 (*Zabrus tenebrioides*))；

[0379] 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*)、骚扰伊蚊 (*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*)、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*)、梨实康瘿蚊 (*Contarinia pyrivora*)、向日葵瘿蚊 (*Contarinia schulzi*)、高粱康瘿蚊 (*Contarinia sorghicola*)、麦黄康瘿蚊 (*Contarinia tritici*))、人皮蝇 (*Cordylobia anthropophaga*)、环足摇蚊 (*Cricotopus sylvestris*)、库蚊属种 (*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.)、橄榄大实蝇 (*Dacus oleae*)、叶瘿蚊属种 (*Dasyneura* spp.) (例如油菜叶瘿蚊 (*Dasineura brassicae*))、地种蝇属种 (*Delia* spp.) (例如葱蝇 (*Delia antiqua*)、麦种蝇 (*Delia coarctata*)、毛跗地种蝇 (*Delia florilega*)、灰地种蝇 (*Delia platura*)、甘蓝地种蝇 (*Delia radicum*))、人肤蝇 (*Dermatobia hominis*)、果蝇属种 (*Drosophila* spp.) (例如黑腹果蝇 (*Drosophila melanogaster*)、斑翅果蝇 (*Drosophila suzukii*))、稻象属种 (*Echinocnemus* spp.)、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.)、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.)、瑞典麦秆蝇 (*Oscinella frit*)、拟长跑摇蚊属种 (*Paratanytarsus* spp.)、*Paralauterborniella subcincta*、泉蝇属种 (*Pegomya* spp.) (例如甜菜泉蝇 (*Pegomya betae*)、天仙子泉蝇 (*Pegomya hyoscyami*)、悬钩子泉蝇 (*Pegomya rubivora*))、白蛉属种 (*Phlebotomus* spp.)、草种蝇属种 (*Phorbia* spp.)、伏蝇属种 (*Phormia* spp.)、酪蝇 (*Piophilus casei*)、*Prodiplosis* 属种、胡萝卜茎蝇 (*Psila rosae*)、绕实蝇属种 (*Rhagoletis* spp.) (例如东部樱桃实蝇 (*Rhagoletis cingulata*)、

核桃绕实蝇 (*Rhagoletis completa*)、黑樱桃实蝇 (*Rhagoletis fausta*)、西部樱桃实蝇 (*Rhagoletis indifferens*)、越桔实蝇 (*Rhagoletis mendax*)、苹果实蝇 (*Rhagoletis pomonella*)、麻蝇属种 (*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*))；

[0380] 来自半翅目 (Hemiptera) 的害虫, 例如 *Acizzia acaciaebaileyanae*、*Acizzia dodonaeae*、木虱 (*Acizzia uncatoides*)、长头蝗 (*Acrida turrita*)、无网长管蚜属种 (*Acyrtosiphon* spp.) (例如豌豆蚜 (*Acyrtosiphon pisum*))、*Acrogonia* 属种、*Aeneolamia* 属种、隆脉木虱属种 (*Agonoscena* spp.)、欧洲甘蓝粉虱 (*Aleyrodes proletella*)、蔗粉穴粉虱 (*Aleurolobus barodensis*)、棉粉虱 (*Aleurothrixus floccosus*)、植莲木虱 (*Allocaridara malayensis*)、芒果叶蝉属种 (*Amrasca* spp.) (例如小绿叶蝉 (*Amrasca bigutulla*)、小叶蝉 (*Amrasca devastans*))、圆尾蚜 (*Anuraphis cardui*)、肾圆盾蚧属种 (*Aonidiella* spp.) (例如红肾圆盾蚧 (*Aonidiella aurantii*)、黄肾圆盾蚧 (*Aonidiella citrina*)、苏铁肾盾蚧 (*Aonidiella inornata*))、梨瘤蚜 (*Aphanostigma piri*)、蚜属种 (*Aphis* spp.) (例如绣线菊蚜 (*Aphis citricola*)、黑豆蚜 (*Aphis craccivora*)、甜菜蚜 (*Aphis fabae*)、草莓根蚜 (*Aphis forbesi*)、大豆蚜 (*Aphis glycines*)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)、常春藤蚜 (*Aphis hederæ*)、葡萄藤蚜 (*Aphis illinoisensis*)、*Aphis middletoni*、鼠李马铃薯蚜 (*Aphis nasturtii*)、夹竹桃蚜 (*Aphis nerii*)、苹果蚜 (*Aphis pomi*)、卷叶蚜 (*Aphis spiraecola*)、*Aphis viburniphila*、葡萄叶蜂 (*Arboridia apicalis*)、*Arytainilla* 属种、小圆盾蚧属种 (*Aspidiella* spp.)、圆盾蚧属种 (*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*)、澳大利亚木虱 (*Blastopsylla occidentalis*)、*Boreioglycaspis melaleucae*、李短尾蚜 (*Brachycaudus helichrysi*)、微管姆属种 (*Brachycolus* spp.)、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*)、丽黄头大叶蝉 (*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*)、黑褐圆盾蚧 (*Chrysomphalus ficus*)、玉米叶蝉 (*Cicadulina mbila*)、*Cocco-mytilus 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、梳木虱属种 (*Ctenarytaina* spp.)、黄翅叶蝶属种 (*Dalbulus* spp.)、柑橘粉虱 (*Dialeurodes citri*)、柑橘木虱 (*Diaphorina citri*)、白背盾蚧属种 (*Diaspis* spp.)、履绵蚧属种 (*Drosicha* spp.)、西圆尾蚜属种 (*Dysaphis* spp.) (例如锈条蚜 (*Dysaphis apiifolia*)、车前草蚜 (*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*)、蚕豆小叶蝉 (*Empoasca fabae*)、苹果小绿叶蝉 (*Empoasca*

maligna)、茄微叶蝉 (*Empoasca solana*)、*Empoasca stevensi*)、绵蚜属种 (*Eriosoma* spp.) (例如美洲绵蚜 (*Eriosoma americanum*)、苹果绵蚜 (*Eriosoma lanigerum*)、梨根绵蚜 (*Eriosoma pyricola*))、斑叶蝉属种 (*Erythroneura* spp.)、*Eucalyptolyma* 属种、褐木虱属种 (*Euphyllura* spp.)、殃叶蝉 (*Euscelis bilobatus*)、拂粉阶属种 (*Ferrisia* spp.)、咖啡地粉蚧 (*Geococcus coffeae*)、*Glycaspis* 属种、银合欢木虱 (*Heteropsylla cubana*)、颊木虱 (*Heteropsylla spinulosa*)、假桃病毒叶蝉 (*Homalodisca coagulata*)、梅大尾蚜 (*Hyalopterus arundinis*)、桃大尾蚜 (*Hyalopterus pruni*)、吹绵蚧属种 (*Icerya* spp.) (例如吹绵蚧壳虫 (*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*))、盾蚧属种 (*Lepidosaphes* spp.) (例如榆蛎盾蚧 (*Lepidosaphes ulmi*))、萝卜蚜 (*Lipaphis erysimi*)、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*)、沫蝶属种 (*Mahanarva* spp.)、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*)、梅瘤蚜 (*Myzus cerasi*)、女贞瘤蚜 (*Myzus ligustri*)、莴菜瘤蚜 (*Myzus ornatus*)、桃蚜 (*Myzus persicae*)、烟蚜 (*Myzus nicotianae*))、莴苣衲长管蚜 (*Nasonovia ribisnigri*)、黑尾叶蝉属种 (*Nephotettix* spp.) (例如黑尾叶蝉 (*Nephotettix cincticeps*)、二条黑尾叶蝉 (*Nephotettix nigropictus*))、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*)、绵粉蚧属种 (*Phenacoccus* spp.) (例如美地绵粉蚧 (*Phenacoccus madeirensis*))、杨平翅绵蚜 (*Phloeomyzus passerinii*)、忽布疣蚜 (*Phorodon humuli*)、葡萄根瘤蚜属种 (*Phylloxera* spp.) (例如 *Phylloxera devastatrix*、警根瘤蚜 (*Phylloxera notabilis*))、苏铁褐点并盾蚧 (*Pinnaspis aspidistrae*)、臀纹粉蚧属种 (*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.) (例如柑栖粉蚧 (*Pseudococcus calceolariae*)、康氏粉蚧 (*Pseudococcus comstocki*)、拟长尾粉蚧 (*Pseudococcus longispinus*)、葡萄粉蚧 (*Pseudococcus maritimus*)、暗色粉蚧 (*Pseudococcus viburni*))、*Psyllopsis* 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.)、*Pyrilla* 属种、笠圆盾蚧属种 (*Quadraspidotus* spp.) (例如胡桃园盾蚧 (*Quadraspidotus juglansregiae*)、杨笠圆盾蚧 (*Quadraspidotus ostreaeformis*)、梨笠盾蚧 (*Quadraspidotus perniciosus*))、*Quesada gigas*、平刺粉蚧属种 (*Rastrococcus* spp.)、缢管蚜属种 (*Rhopalosiphum* spp.) (例如玉米蚜 (*Rhopalosiphum maidis*)、苹

草缢管蚜 (*Rhopalosiphum oxyacanthae*)、稻麦蚜 (*Rhopalosiphum padi*)、红腹缢管蚜 (*Rhopalosiphum rufiabdominale*)、黑盔蚧属种 (*Saissetia* spp.) (例如咖啡黑盔蚧 (*Saissetia coffeae*)、*Saissetia miranda*、*Saissetia neglecta*、黑蜡蚧 (*Saissetia oleae*)、葡萄带叶蝉 (*Scaphoideus titanus*)、麦二叉蚜 (*Schizaphis graminum*)、苏铁刺圆盾蚧 (*Selenaspidus articulatus*)、麦长管蚜 (*Sitobion avenae*)、长唇基飞虱属种 (*Sogatia* spp.)、白背飞虱 (*Sogatella furcifera*)、稻飞虱属种 (*Sogatodes* spp.)、*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.) ;

[0381] 来自异翅亚目 (*Heteroptera*) 的害虫, 例如, 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.)、微刺盲蝽属种 (*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.)、绿盲蝽 (*Creontiades dilutus*)、胡椒缘蝽 (*Dasynus piperis*)、*Dichelops furcatus*、厚氏长棒网蝽 (*Diconocoris hewetti*)、棉红蝽属种 (*Dysdercus* spp.)、美洲蝽属种 (*Euschistus* spp.) (例如英雄美洲蝽 (*Euschistus heros*)、褐臭蝽 (*Euschistus servus*)、三色美洲蝽 (*Euschistus tristigma*)、广斑臭蝽 (*Euschistus variolarius*)、扁盾蝽属种 (*Eurygaster* spp.)、茶翅蝽 (*Halyomorpha halys*)、角盲蝽属种 (*Heliopeltis* spp.)、*Horcias nobilellus*、稻缘蝽属种 (*Leptocorisa* spp.)、稻缘蝽象 (*Leptocorisa varicornis*)、西部喙缘蝽 (*Leptoglossus occidentalis*)、叶缘缘蝽 (*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*)、黑摩盲蝽 (*Monalonion atratum*)、绿蝽属种 (*Nezara* spp.) (例如稻绿蝽 (*Nezara viridula*)、稻蝽属种 (*Oebalus* spp.)、方背皮蝽 (*Piesma quadrata*)、壁蝽属种 (*Piezodorus* spp.) (例如盖德拟壁蝽 (*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.) ;

[0382] 来自膜翅目 (*Hymenoptera*) 的害虫, 例如, 顶切叶蚁属种 (*Acromyrmex* spp.)、菜叶蜂属种 (*Athalia* spp.) (例如黄翅菜叶蜂 (*Athalia rosae*)、叶蚁属种 (*Atta* 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 *Hoplocampa cookei*、苹叶蜂 (*Hoplocampa testudinea*)、毛蚁属种 (*Lasius* spp.)、阿根廷蚁 (*Linepithema humile*)、小家蚁 (*Monomorium pharaonis*)、树蜂虫 (*Sirex* spp.)、红火蚁 (*Solenopsis invicta*)、臭蚁属种 (*Tapinoma* spp.)、树蜂属种 (*Urocerus*

spp.)、胡蜂属种 (*Vespa* spp.) (例如黄边胡蜂 (*Vespa crabro*))、黑树蜂属种 (*Xeris* spp.) ;

[0383] 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*) ;

[0384] 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.)、稻麦小白蚁 (*Microtermes obesi*)、土白蚁属种 (*Odontotermes* spp.)、散白蚁属种 (*Reticulitermes* spp.) (例如黄肢散白蚁 (*Reticulitermes flavipes*)、美国散白蚁 (*Reticulitermes hesperus*)) ;

[0385] 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 (*Argyroplote* spp.)、甘蓝夜蛾 (*Barathra brassicae*)、粘弄蝶 (*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*)、苹果小卷蛾 (*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*))、色卷蛾属种 (*Choristoneura* spp.)、葡萄果蠹蛾 (*Clysia ambiguella*)、纵卷叶野螟属种 (*Cnaphalocerus* spp.)、稻纵卷叶野螟 (*Cnaphalocrocis medinalis*)、云卷蛾属种 (*Cnephasia* spp.)、茶枝尖细蛾属种 (*Conopomorpha* spp.)、象甲属种 (*Conotrachelus* spp.)、*Copitarsia* 属种、小卷蛾属种 (*Cydia* spp.) (例如豆荚小卷蛾 (*Cydia nigricana*)、苹果蠹蛾 (*Cydia pomonella*))、*Dalaca noctuides*、绢野螟属种 (*Diaphania* spp.)、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*)、荚斑螟属种 (*Etiella* spp.)、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*))、甘蔗螟属种 (*Hedylepta* spp.)、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*)、贪夜蛾属种 (*Laphygma*

spp.)、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*)、豆荚野螟 (*Maruca testulalis*)、甘蓝夜蛾 (*Mamestra brassicae*)、稻暮眼蝶 (*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、麦秆夜蛾属种 (*Oria* spp.)、瘤丛螟属种 (*Orthaga* spp.)、秆野螟属种 (*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*) (= 钻石背蛾 (*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.) (例如三化螟 (*Schoenobius bipunctifer*))、白禾螟属种 (*Scirpophaga* spp.) (例如稻白螟属种 (*Scirpophaga innotata*))、黄地老虎 (*Scotia segetum*)、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.)、花生麦蛾 (*Stomopteryx subsecivella*)、透翅蛾属种 (*Synanthedon* spp.)、安第斯马铃薯块茎蛾 (*Tecia solanivora*)、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.) ;

[0386] 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*)、乌苏里拟寰螽 (*Paratlanticus ussuriensis*)、沙漠蝗 (*Schistocerca gregaria*) ;

[0387] 来自虱目 (Phthiraptera) 的害虫,例如,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.)、根瘤蚜 (*Phylloxera vastatrix*)、阴虱 (*Ptirus pubis*)、啮毛虱属种 (*Trichodectes* spp.) ;

[0388] 来自啮虫目 (Psocoptera) 的害虫,例如,粉啮虫属种 (*Lepinatus* spp.)、书虱属种 (*Liposcelis* spp.) ;

[0389] 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*))、跳蚤 (*Pulex irritans*)、穿皮潜蚤 (*Tunga penetrans*)、印鼠客蚤 (*Xenopsylla cheopis*) ;

[0390] 来自缨翅目 (Thysanoptera) 的害虫,例如,玉米黄呆蓟马 (*Anaphothrips obscurus*)、稻蓟马 (*Baliothrips biformis*)、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*)、麦花蓟马 (*Frankliniella tritici*)、越桔花蓟马 (*Frankliniella vaccinii*)、威廉期花蓟马 (*Frankliniella williamsi*))、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.)、小豆蓴带蓟马 (*Taeniothrips cardamoni*)、蓟马属种 (*Thrips* spp.) (例如棕榈蓟马 (*Thrips palmi*)、烟蓟马 (*Thrips tabaci*)) ;

[0391] 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*) ;

[0392] 来自综合纲 (Symphyla) 的害虫,例如,幺蚰属种 (*Scutigera* spp.) (例如无斑点幺蚰 (*Scutigera immaculata*)) ;

[0393] 来自软体动物 (Mollusca) 门的害虫,例如来自双壳纲 (*Bivalvia*),如饰贝属种 (*Dreissena* spp.) ,

[0394] 以及来自腹足纲 (*Gastropoda*) 的害虫,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.) ;

[0395] 来自扁形动物门 (Plathelminthes) 和线虫纲 (Nematoda) 的动物寄生虫和人体寄生虫,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.)、似绕体线虫属种 (*Heligmosomoides* spp.)、异刺线虫属种 (*Heterakis* spp.)、膜壳绦虫属种 (*Hymenolepis* spp.)、猪圆线虫属种 (*Hyostrogylus* 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 (*Mesocestoides* 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.)、Ollulanus 属种、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.)、胃线虫属种 (*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.)、*Passalurus* 属种、原圆线虫属种 (*Protostrongylus* spp.)、裂体吸虫属种 (*Schistosoma* spp.)、鬃丝虫属种 (*Setaria* spp.)、*Spirocerca* 属种、冠丝虫属种 (*Stephanofilaria* spp.)、冠线虫属种 (*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.)；

[0396] 来自线虫动物门 (Nematoda) 的植物害虫, 即植物寄生线虫, 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.) (例如瘟疫坏死线虫 (*Cacopaurus pestis*))、小环线虫属种 (*Criconemella* spp.) (例如弯曲小环线虫 (*Criconemella curvata*)、刻线小环线虫 (*Criconemella onoensis*)、装饰小环线虫 (*Criconemella ornata*)、*Criconemella rusium*、薄叶小环线虫 (*Criconemella xenoplax* (=环腐线虫 (*Mesocriconema xenoplax*))))、轮线虫属种 (*Criconemoides* spp.)

(例如 *Criconemoides ferniae*、*Criconemoides onoense*、*Criconemoides ornatum*)、双垫刃属种 (*Ditylenchus* spp.) (例如续断双垫刃线虫 (*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 (*Hemicycliophora* spp.)、异皮线虫属种 (*Heterodera* spp.) (例如燕麦胞囊线虫 (*Heterodera avenae*)、大豆胞囊线虫 (*Heterodera glycines*)、甜菜胞囊线虫 (*Heterodera schachtii*))、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*)、伪根结线虫 (*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.)、拟滑刃线虫属种 (*Paraphelenchus* spp.)、拟毛刺线虫属种 (*Paratrichodorus* spp.) (例如次拟毛刺线虫 (*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.)、斑皮胞囊线虫属种 (*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.)、小麦根瘿线虫 (*Subanguina* spp.)、毛刺线虫属种 (*Trichodorus* spp.) (例如短粗根毛刺线虫 (*Trichodorus obtusus*)、原始毛刺线虫 (*Trichodorus primitivus*))、矮化线虫属种 (*Tylenchorhynchus* spp.) (例如饰环矮化线虫 (*Tylenchorhynchus annulatus*))、麦线虫属种 (*Tylenchulus* spp.) (例如柑桔根线虫 (*Tylenchulus semipenetrans*))、剑线虫属种 (*Xiphinema* spp.) (例如标准剑线虫 (*Xiphinema index*))；

[0397] 此外，可以防治来自原生动物 (Protozoa) 亚门、球虫目 (Coccidia) 的害虫，例如艾美球虫属种 (*Eimeria* spp.)。

[0398] 在一定的浓度或施用率下，式 (I) 的化合物还可任选地用作除草剂、安全剂、生长调节剂或改善植物性能的试剂，用作杀菌剂或杀配子剂，例如用作杀真菌剂、抗霉菌剂、杀细菌剂、杀病毒剂（包括抗类病毒试剂）或用作抵抗 ML0（类支原体生物）和 RL0（类立克次氏体生物）的试剂。如果合适，其还可以用作合成其他活性成分的中间体或前体。

[0399] 制剂

[0400] 本发明还涉及包含至少一种式 (I) 的化合物的制剂和由其制备的作为农药的使用形式，例如浸透、滴注和喷雾液体。在某些情况下，使用形式包括具有改善作用的其他农药和 / 或佐剂如渗透剂，例如植物油（如油菜籽油、向日葵油）、矿物油（如石蜡油）、植物脂肪酸的烷基酯（如油菜籽油甲酯或大豆油甲酯）、或烷醇烷氧基化物；和 / 或展着剂 (spreader)，例如烷基硅氧烷和 / 或盐（如有机或无机铵盐或磷盐，例如硫酸铵或磷酸氢二铵）；和 / 或保留促进剂，例如磺基琥珀酸二辛酯或羟丙基瓜尔胶聚合物；和 / 或湿润剂，例如甘油；和 / 或肥料，例如含铵、含钾或含磷的肥料。

[0401] 常用的制剂为，例如水溶性液体 (SL)、乳油 (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由例如 Crop Life International 记载在以下文献中: 农药标准 (Pesticide Specifications)、用于农药的 FAO 和 WHO 标准的发展和用手册 (Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides)、FAO 农作物生产与保护文件-173 (FAO Plant Production and Protection Papers)——由 FAO/WHO 关于农药标准的联合会制订, 2004, ISBN :9251048576。除了一种或多种式 (I) 的化合物外, 所述制剂还任选地包含其他农用化学活性成分。

[0402] 这些优选地为包含下述物质的制剂或使用形式: 助剂, 如填充剂、溶剂、自发性促进剂、载体、乳化剂、分散剂、防冻剂、灭微生物剂 (biocide)、增稠剂; 和或其他助剂, 如佐剂。在本上下文中, 佐剂是提高制剂的生物活性的组分, 而该组分本身不具有生物活性。佐剂的实例为促进保留、铺展性能、附着到叶面或渗透的试剂。

[0403] 这些制剂以已知方式制备, 例如通过将式 (I) 的化合物与助剂混合, 所述助剂为例如填充剂、溶剂和 / 或固体载体和 / 或其他助剂如表面活性剂。制剂在合适的设备中或在施用前或施用过程中制备。

[0404] 所用助剂可为适用于赋予式 (I) 的化合物的制剂或由这些制剂制备的使用形式 (如即用型 (ready-to-use) 农药, 如喷雾液体或拌种剂产品) 具体性能的物质, 所述具体性能为例如特定的物理性能、技术性能和 / 或生物学性能。

[0405] 合适的填充剂是, 例如水、极性和非极性有机化学液体, 例如选自: 芳族烃或非芳族烃类 (如石蜡、烷基苯、烷基萘、氯苯)、醇类和多元醇类 (若合适, 其还可被取代、醚化和 / 或酯化)、酮类 (如丙酮、环己酮)、酯类 (包括脂肪和油) 和 (聚) 醚、未取代的和取代的胺类、酰胺类、内酰胺类 (如 N- 烷基吡咯烷酮) 和内酯类、矾类和亚矾类 (如二甲基亚矾)。

[0406] 如果所用的填充剂是水, 则还可能使用例如有机溶剂作为助溶剂。有用的液体溶剂主要包括: 芳族化合物, 如二甲苯、甲苯或烷基萘; 氯代芳族烃或氯代脂肪族烃, 如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷; 脂肪族烃, 如环己烷或石蜡, 如矿物油馏分、矿物油和植物油; 醇, 如丁醇或乙二醇及其醚和酯; 酮, 如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮; 强极性溶剂, 如二甲基甲酰胺和二甲基亚矾或水。

[0407] 原则上, 可使用任何合适的溶剂。合适的溶剂的实例为芳族烃, 如二甲苯、甲苯或烷基萘; 氯代芳族烃或氯代脂肪族烃, 如氯苯、氯乙烯、二氯甲烷; 脂肪族烃, 如环己烷、石蜡、石油馏分、矿物油和植物油; 醇, 如甲醇、乙醇、异丙醇、丁醇或乙二醇及其醚和酯; 酮, 如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮; 强极性溶剂, 如二甲基亚矾; 以及水。

[0408] 原则上, 可使用所有合适的载体。有用的载体尤其包括: 例如, 铵盐和磨碎的天然矿物, 如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、硅镁土、蒙脱石或硅藻土; 和磨碎的合成矿物质, 如细分散的二氧化硅、氧化铝和天然或合成的硅酸盐、树脂、蜡和 / 或固体肥料。同样可使用这类载体的混合物。用于颗粒剂的有用载体包括: 例如, 压碎并分级的天然岩石, 如方解石、大理石、浮石、海泡石、白云石; 以及无机和有机粉的合成颗粒; 以及有机材料的颗粒, 如锯屑、纸、椰壳、玉米穗轴和烟草茎。

[0409] 还可使用液化的气态填充剂或溶剂。特别合适的是在标准温度和标准压力下为气态的那些填充剂或载体, 例如, 气溶胶喷射剂 (aerosol propellantgase), 如卤代烃, 或丁烷、丙烷、氮气和二氧化碳。

[0410] 具有离子或非离子性质的乳化剂和 / 或发泡剂、分散剂或润湿剂、或这些表面活性物质的混合物的实例为：聚丙烯酸的盐；木素磺酸的盐；苯酚磺酸的盐或萘磺酸盐；环氧乙烷与脂肪醇或脂肪酸或脂肪胺或取代的酚（优选烷基酚或芳基酚）的缩聚物；磺基琥珀酸盐的盐；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；以包含硫酸盐、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、蛋白质水解产物、木质素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。如果上述式 (I) 的化合物之一和 / 或上述惰性载体之一不溶于水并且施用在水中进行时，则表面活性剂的存在是有利的。

[0411] 可存在于制剂和由此衍生的使用形式中的其他助剂为着色剂，例如无机颜料，如氧化铁、氧化钛、普鲁士蓝；和有机染料，如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料；以及营养物和微量营养物，如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

[0412] 另外，可存在稳定剂，如低温稳定剂、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂或提高化学和 / 或物理稳定性的其他试剂。另外，可存在发泡剂或消泡剂。

[0413] 此外，制剂和由其衍生的使用形式还可包含下述物质作为额外的助剂：粘着剂，如羧甲基纤维素；以及粉末、颗粒、乳胶形式的天然和合成聚合物，如阿拉伯树胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯；或者天然磷脂，如脑磷脂、卵磷脂和合成磷脂。其他可能的助剂为矿物油和植物油。

[0414] 任选地，其他助剂还可存在于制剂和自其衍生的使用形式中。这种添加剂的实例包括香料、保护胶体、粘合剂 (binder)、胶粘剂 (adhesive)、增稠剂、触变剂、渗透剂、保留促进剂、稳定剂、螯合剂、络合剂、湿润剂和展着剂。一般而言，式 (I) 的化合物可与通常用于制剂目的的任何固体或液体添加剂结合。

[0415] 有用的保留促进剂包括降低动力学表面张力的所有那些物质，如磺基琥珀酸二辛酯；或提高粘弹性的所有那些物质，如羟丙基瓜尔胶聚合物。

[0416] 在本发明的上下文中，有用的渗透剂包括通常用于增强活性农业化学成分向植物内渗透的所有那些物质。在本文中，渗透剂通过这样的方式定义：它们由（通常是含水的）施用液体和 / 或由喷雾涂层渗透到植物的表皮，从而增加活性成分在表皮中的流动性的能力。文献 (Baur 等人, 1997, Pesticide Science 51, 131-152) 中记载的方法可用于测定这种特性。实例包括：醇烷氧基化物，如椰子脂肪乙氧基化物 (10) 或异十三烷乙氧基化物 (12)；脂肪酸酯，如菜籽油甲酯或大豆油甲酯；脂肪胺烷氧基化物，如牛油胺乙氧基化物 (15)；或铵盐和 / 或磷盐，如硫酸铵或磷酸氢二铵。

[0417] 制剂优选含有 0.00000001 重量%至 98 重量%的式 (I) 的化合物，特别优选 0.01 重量%至 95 重量%的式 (I) 的化合物，更优选 0.5 重量%至 90 重量%的式 (I) 的化合物，基于所述制剂的重量计。

[0418] 在由制剂（尤其是农药）制备的使用形式中式 (I) 的化合物的含量可在宽范围内变化。式 (I) 的化合物在使用形式中的浓度通常可为 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%，基于使用形式的重量计。施用以适合于使用形式的常规方式进行。

[0419] 混合物

[0420] 式 (I) 的化合物还可以与下述一种或多种物质的混合物使用：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、杀微生物剂、有益生物、除草剂、肥料、鸟驱散剂、植物增强剂 (phytotonic)、灭菌剂、安全剂、化学信息素和 / 或植物生长调节剂,从而例如拓宽作用谱、延长作用持续时间、增强作用速率、防止排斥或防止抗性发展。另外,这类活性成分组合可以改善植物生长和 / 或对非生物因素 (如高温或低温)、对干旱或对高水含量或土壤盐度的耐受性。还可能改善开花和结果性能、优化发芽能力和根系发育、促进采收和提高产量、影响熟化、改善采收产品的品质和 / 或营养价值、延长储存周期和 / 或改善采收产品的加工性能。

[0421] 另外,式 (I) 的化合物可以存在于与其他活性成分或化学信息素如引诱剂和 / 或鸟驱散剂和 / 或植物活化剂和 / 或生长调节剂和 / 或肥料的混合物中。同样地,式 (I) 的化合物可以与用于改善植物性能如生长、产量和采收材料的品质的试剂组成的混合物形式使用。

[0422] 在本发明的一个特别的实施方案中,式 (I) 的化合物为制剂的形式或由这些制剂与其他化合物的混合物制备的使用形式,优选为如下所述的那些。

[0423] 如果下文提到的化合物之一可以多种互变异构形式存在,则这些形式即使在各种情况下没有明确提及也包括在内。

[0424] 杀昆虫剂 / 杀螨剂 / 杀线虫剂

[0425] 本文中以它们的“通用名称”提及的活性成分是已知的,并且记载在例如 The Pesticide Manual, 16th ed., British Crop Protection Council 2012, 或者可以在互联网 (例如 <http://www.alanwood.net/pesticides>) 上检索到。

[0426] (1) 乙酰胆碱酯酶 (AChE) 抑制剂, 例如氨基甲酸酯类, 例如棉铃威 (alanycarb)、涕灭威 (aldicarb)、噁虫威 (bendiocarb)、丙硫克百威 (benfuracarb)、丁酮威 (butocarboxim)、丁酮砜威 (butoxycarboxim)、胺甲萘 (carbaryl)、卡巴呋喃 (carbofuran)、丁硫克百威 (carbosulfan)、乙硫苯威 (ethiofencarb)、仲丁威 (fenobucarb)、伐虫脒 (formetanate)、呋线威 (furathiocarb)、异丙威 (isoprocarb)、灭虫威 (methiocarb)、灭多威 (methomyl)、速灭威 (metolcarb)、杀线威 (oxamyl)、抗蚜威 (pirimicarb)、残杀威 (propxur)、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, 例如高灭磷 (acephate)、甲基吡啶磷 (azamethiphos)、乙基谷硫磷 (azinphos-ethyl)、谷硫磷 (azinphos-methyl)、硫线磷 (cadusafos)、氯氧磷 (chlorethoxyfos)、毒虫畏 (chlorfenvinphos)、氯甲硫磷 (chlormephos)、毒死蜱 (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)、杀螟松 (fenitrothion)、倍硫磷 (fenthion)、噻唑磷 (fosthiazate)、庚烯磷 (heptenophos)、imicyafos、异柳磷 (isofenphos)、邻-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸异丙酯、异噁唑啉 (isoxathion)、马拉硫磷 (malathion)、灭蚜磷 (mecarbam)、甲胺磷 (methamidophos)、杀扑磷 (methidathion)、速灭磷 (mevinphos)、久效磷 (monocrotophos)、二溴磷 (naled)、氧乐果 (omethoate)、

亚砷磷 (oxydemeton-methyl)、对硫磷 (parathion)、甲基对硫磷 (parathion-methyl)、稻丰散 (phenthoate)、甲拌磷 (phorate)、伏杀磷 (phosalone)、亚胺硫磷 (phosmet)、磷胺 (phosphamidon)、膈硫磷 (phoxim)、甲基嘧啶磷 (pirimiphos-methyl)、丙溴磷 (profenofos)、胺丙畏 (propetamphos)、丙硫磷 (prothiofos)、吡啶硫磷 (pyraclofos)、吡啶硫磷 (pyridaphenthion)、喹硫磷 (quinalphos)、治螟磷 (sulfotep)、丁基嘧啶磷 (tebupirimfos)、双硫磷 (temephos)、特丁硫磷 (terbufos)、司替罗磷 (tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷 (thiometon)、三唑磷 (triazophos)、trichlorfon 和蚜灭磷 (vamidothion)。

[0427] (2) GABA- 门控氯通道拮抗剂, 例如环戊二烯有机氯类, 例如氯丹 (chlordane) 和硫丹 (endosulfan); 或苯基吡啶类 (fiproles), 例如乙虫腈 (ethiprole) 和氟虫腈 (fipronil)。

[0428] (3) 钠通道调节剂 / 电压门控性钠通道阻滞剂, 例如拟除虫菊酯 (pyrethroid) 类, 例如氟丙菊酯 (acrinathrin)、丙烯除虫菊酯 (allethrin)、d- 顺 - 反丙烯除虫菊酯 (d-cis-trans allethrin)、d- 反丙烯除虫菊酯 (d-trans allethrin)、联苯菊酯 (bifenthrin)、生物烯丙菊酯 (bioallethrin)、生物烯丙菊酯 S- 环戊烯基异构体 (bioallethrin S-cyclopentenyl isomer)、生物苄呋菊酯 (bioresmethrin)、乙氰菊酯 (cycloprothrin)、氟氯氰菊酯 (cyfluthrin)、 β - 氟氯氰菊酯 (beta-cyfluthrin)、三氟氯氰菊酯 (cyhalothrin)、 λ - 三氟氯氰菊酯 (lambda-cyhalothrin)、 γ - 三氟氯氰菊酯 (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)、依芬普司 (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)、苄腈醚 (halfenprox)、炔咪菊酯 (imiprothrin)、噻噁菊酯 (kadethrin)、苄氯菊酯 (permethrin)、苯醚菊酯 [(1R)- 反式异构体] (phenothrin [(1R)-trans isomer])、炔丙菊酯 (prallethrin)、除虫菊酯 (pyrethrine、pyrethrum)、苄呋菊酯 (resmethrin)、氟硅菊酯 (silaflluofen)、七氟菊酯 (tefluthrin)、胺菊酯 (tetramethrin)、胺菊酯 [(1R) 异构体] (tetramethrin [(1R) isomers])、四溴菊酯 (tralomethrin) 和四氟苯菊酯 (transfluthrin); 或 DDT; 或甲氧氯。

[0429] (4) 烟碱能乙酰胆碱受体 (nAChR) 激动剂, 例如新烟碱类 (neonicotinoids), 例如啉虫脒 (acetamiprid)、噻虫胺 (clothianidin)、呋虫胺 (dinotefuran)、吡虫啉 (imidacloprid)、烯啶虫胺 (nitenpyram)、噻虫啉 (thiacloprid) 和噻虫嗪 (thiamethoxam) 或尼古丁 (nicotine) 或氟啉虫胺腈 (sulfoxaflor)。

[0430] (5) 烟碱能乙酰胆碱受体 (nAChR) 的变构活化剂, 例如多杀菌素类 (spinosyns), 如乙基多杀菌素 (spinetoram) 和多杀菌素 (spinosad)。

[0431] (6) 氯通道活化剂, 例如, 阿维菌素类 / 米尔倍霉素类 (avermectins / milbemycins), 例如阿维菌素 (abamectin)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐 (emamectin

benzoate)、雷皮菌素 (lepimectin) 和灭螨菌素 (milbemectin)。

[0432] (7) 保幼激素模仿物,例如,保幼激素类似物如烯虫乙酯 (hydroprene)、烯虫炔酯 (kinoprene) 和烯虫酯 (methoprene) 或苯氧威 (fenoxycarb) 或蚊蝇醚 (pyriproxyfen)。

[0433] (8) 具有未知的或非特异性作用机制的活性成分,例如

[0434] 烷基卤化物,例如甲基溴化物和其他烷基卤化物;或氯化苦 (chloropicrine) 或硫酰氟或硼砂或吐酒石 (tartar emetic)。

[0435] (9) 选择性拒食剂,例如吡蚜酮 (pymetrozine) 或氟啶虫酰胺 (flonicamid)。

[0436] (10) 螨生长抑制剂,例如四螨嗪、噻螨酮和氟螨嗪 (diflovidazin) 或乙螨唑 (etoxazole)。

[0437] (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*)、苏云金芽孢杆菌鲇泽亚种 (*Bacillus thuringiensis* subspecies *aizawai*)、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种 (*Bacillus thuringiensis* subspecies *kurstaki*)、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种 (*Bacillus thuringiensis* subspecies *tenebrionis*) 和 BT 植物蛋白:Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab1。

[0438] (12) 氧化磷酸化抑制剂、ATP 干扰剂,例如丁醚脲或有机锡化合物,例如三唑锡、三环锡和苯丁锡 (fenbutatin oxide) 或克螨特 (propargite) 或四氯杀螨砒 (tetradifon)。

[0439] (13) 中断 H 质子梯度的氧化磷酸化去耦剂,例如虫螨腈 (chlorfenapyr)、二硝甲酚 (DNOC) 和氟虫胺 (sulfluramid)。

[0440] (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 (thiocyclam) 和杀虫双 (thiosultap-sodium)。

[0441] (15) 0 型几丁质生物合成抑制剂,例如双三氟虫脲 (bistrifluron)、定虫隆 (chlofluazuron)、二氟脲 (diflubenzuron)、氟环脲 (flucycloxuron)、氟虫脲 (flufenoxuron)、氟铃脲 (hexaflumuron)、氯芬奴隆 (lufenuron)、双苯氟脲 (novaluron)、多氟脲 (noviflumuron)、氟苯脲 (teflubenzuron) 和杀铃脲 (triflumuron)。

[0442] (16) 1 型几丁质生物合成抑制剂,例如噻嗪酮 (buprofezin)。

[0443] (17) 蜕皮抑制剂 (尤其对于双翅目,即双翅类),例如灭蝇胺 (cyromazine)。

[0444] (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)。

[0445] (19) 章鱼胺能激动剂,例如双甲脒 (amitraz)。

[0446] (20) 复合物 -III 型电子传递抑制剂,例如氟蚁腓 (hydramethylnone),或灭螨醌 (acequinocyl),或噻螨酯 (fluacrypyrim)。

[0447] (21) 复合物 -I 型电子传递抑制剂,例如 METI 杀螨剂,例如喹螨醚 (fenazaquin)、唑螨酯 (fenpyroximate)、噻螨醚 (pyrimidifen)、哒螨灵 (pyridaben)、吡螨胺 (tebufenpyrad) 和唑虫酰胺 (tolfenpyrad);或鱼藤酮 (rotenone) (鱼藤属)。

[0448] (22) 电压门控钠通道阻断剂,例如茚虫威 (indoxacarb) 或氰氟虫腚 (metaflumizone)。

[0449] (23) 乙酰基 -CoA 羧化酶的抑制剂,例如季酮酸 (tetronic) 和特特拉姆酸

(tetramic acid) 衍生物, 例如螺螨酯 (spirodiclofen)、螺甲螨酯 (spiromesifen) 和螺虫乙酯 (spirotetramat)。

[0450] (24) 复合物 -IV 型电子传递抑制剂, 例如磷, 如磷化铝、磷化钙、磷化氢和磷化锌; 或氰化物。

[0451] (25) 复合物 -II 型电子传递抑制剂, 例如腈吡螨酯 (cyenopyrafen) 和丁氟螨酯 (cyflumetofen)。

[0452] (28) 兰尼碱受体效应剂, 例如二酰胺类, 如氯虫苯甲酰胺 (chlorantraniliprole)、溴氰虫酰胺 (cyantraniliprole) 和氟虫酰胺 (flubendiamide);

[0453] 其他活性成分, 例如 afidopyropen、印楝素 (azadirachtin)、benclothiaz、苯螨特 (benzoximate)、联苯肼酯 (bifenazate)、溴螨酯 (bromopropylate)、灭螨锰 (chinomethionat)、冰晶石 (cryolite)、三氯杀螨醇 (dicofol)、氟螨嗪 (diflovidazin)、氟噻虫砒 (fluensulphone)、flometoquin、嘧虫胺 (flufenerim)、氟菌螨酯 (flufenoxystrobin)、丁虫腈 (flufiprole)、氟吡菌酰胺 (fluopyram)、flupyradifurone、呋喃虫酰肼 (fufenozide)、heptafluthrin、氯噻啉 (imidaclothiz)、异菌脲 (iprodione)、氯氟醚菊酯 (meperfluthrin)、哌虫啉 (paichongding)、pyflubumide、pyrfluquinazon、嘧螨胺 (pyriminostrobin)、四氟醚菊酯 (tetramethylfluthrin) 和碘甲烷 (iodomethane); 以及基于坚强芽孢杆菌 (*Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo)) 的药剂, 以及下列化合物: 3-溴-N-{2-溴-4-氯-6-[(1-环丙基乙基)氨基甲酰基]苯基}-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-甲酰胺 (由 W02005/077934 已知) 和 1-{2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亚磺酰基]苯基}-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺 (由 W02006/043635 已知)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吡啶-3,4'-哌啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮 (由 W02003/106457 已知)、2-氯-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]哌啶-4-基}-4-(三氟甲基)苯基]异烟碱酰胺 (由 W02006/003494 已知)、3-(2,5-二甲基苯基)-4-羟基-8-甲氧基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮 (由 W02009/049851 已知)、3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基碳酸乙酯 (由 W02009/049851 已知)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基哌啶-1-基)-5-氟嘧啶 (由 W02004/099160 已知)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3-氯苯基)嘧啶 (由 W02003/076415 已知)、PF1364 (CAS 登记号 1204776-60-2)、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-{2-氧代-2-[(2,2,2-三氟乙基)氨基]乙基}苯甲酰胺 (由 W02005/085216 已知)、4-{5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-N-{2-氧代-2-[(2,2,2-三氟乙基)氨基]乙基}-1-萘甲酰胺 (由 W02009/002809 已知)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基}氨基)-5-氯-3-甲基苯甲酰基]-2-甲基肼羧酸甲酯 (由 W02005/085216 已知)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基}氨基)-5-氰基-3-甲基苯甲酰基]-2-乙基肼羧酸甲酯 (由 W02005/085216 已知)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基}氨基)-5-氰基-3-甲基苯甲酰基]-2-甲基肼羧酸甲酯 (由 W02005/085216 已知)、2-[3,5-二溴-2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基}氨基)苯甲酰基]-2-乙基肼羧酸甲酯 (由 W02005/085216 已知)、1-(3-氯

吡啶-2-基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-(甲基氨基甲酰基)苯基]-3-[[5-(三氟甲基)-2H-四唑-2-基]甲基]-1H-吡唑-5-甲酰胺(由W02010/069502已知)、N-[2-(5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-甲酰胺(由CN102057925已知)、3-氯-N-(2-氰基丙-2-基)-N-[4-(1,1,1,2,3,3,3-七氟丙-2-基)-2-甲基苯基]酞酰胺(由W02012/034472已知)、8-氯-N-[(2-氯-5-甲氧基苯基)磺酰基]-6-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺(由W02010/129500已知)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-(1-氧硫杂环丁烷-3-基)苯甲酰胺(由W02009/080250已知)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-(1-氧硫杂环丁烷-3-基)苯甲酰胺(由W02012/029672已知)、1-[(2-氯-1,3-噻唑-5-基)甲基]-4-氧代-3-苯基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶-1-鎓-2-酚盐(由W02009/099929已知)、1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-4-氧代-3-苯基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶-1-鎓-2-酚盐(由W02009/099929已知)、(5S,8R)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-9-硝基-2,3,5,6,7,8-六氢-1H-5,8-环氧咪唑并[1,2-a]氮杂卓(由W02010/069266已知)、(2E)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-N'-硝基-2-亚戊基胍甲脒(由W02010/060231已知)、4-(3-{2,6-二氯-4-[(3,3-二氯丙-2-烯-1-基)氧基]苯氧基}丙氧基)-2-甲氧基-6-(三氟甲基)嘧啶(由CN101337940已知)、N-[2-(叔丁基氨基甲酰基)-4-氯-6-甲基苯基]-1-(3-氯吡啶-2-基)-3-(氟甲氧基)-1H-吡唑-5-甲酰胺(由W02008/134969已知)。

[0454] 杀真菌剂

[0455] 在本文中通过它们的通用名称确定的活性成分是已知的并且记载在例如“Pesticide Manual”或互联网(例如:<http://www.alanwood.net/pesticides>)上。

[0456] (1) 麦角甾醇生物合成抑制剂,例如(1.1)杀螟丹(aldimorph)、(1.2)氧环唑(azaconazole)、(1.3)双苯三唑醇(bitertanol)、(1.4)糠菌唑(bromuconazole)、(1.5)环丙唑醇(cyproconazole)、(1.6)苄氯三唑醇(diclobutrazole)、(1.7)苯醚甲环唑(difenoconazole)、(1.8)烯唑醇(diniconazole)、(1.9)高效烯唑醇(diniconazole-M)、(1.10)吗菌灵(dodemorph)、(1.11)吗菌灵乙酸盐(dodemorph acetate)、(1.12)氟环唑(epoxiconazole)、(1.13)乙环唑(etaconazole)、(1.14)氯苯嘧啶醇(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)呋嘧啶醇(flurprimidol)、(1.21)氟硅唑(flusilazole)、(1.22)粉唑醇(flutriazole)、(1.23)呋菌唑(furconazole)、(1.24)顺呋醚唑(furconazole-cis)、(1.25)己唑醇(hexaconazole)、(1.26)抑霉唑(imazalil)、(1.27)抑霉唑硫酸盐(imazalil sulfate)、(1.28)酰胺唑(imibenconazole)、(1.29)种菌唑(ipconazole)、(1.30)叶菌唑(metconazole)、(1.31)腈菌唑(myclobutanil)、(1.32)萘替芬(naftifine)、(1.33)氟苯嘧啶醇(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) 三唑醇 (triadimenol)、(1.52) 克啉菌 (tridemorph)、(1.53) 氟菌唑 (triflumizole)、(1.54) 噻氮灵 (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-甲基酰亚胺基甲酰胺、(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}酰亚胺基甲酰胺、(1.64) 邻-[1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁烷-2-基]-1H-咪唑-1-硫代甲酸酯、(1.65) 啉菌噁唑 (pyrisoxazole)。

[0457] (2) 呼吸抑制剂 (呼吸链抑制剂), 例如 (2.1) 联苯吡菌胺 (bixafen)、(2.2) 啉酰菌胺 (boscalid)、(2.3) 萎锈灵 (carboxin)、(2.4) 二氟林 (diflumetorim)、(2.5) 甲呋酰胺 (fenfuram)、(2.6) 氟吡菌酰胺 (fluopyram)、(2.7) 氟酰胺 (flutolanil)、(2.8) 氟唑菌酰胺 (fluxapyroxad)、(2.9) 呋吡菌胺 (furametpyr)、(2.10) 拌种胺 (furmecyclox)、(2.11) 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 的吡唑萘菌胺混合物、(2.12) 吡唑萘菌胺 (反式差向异构外消旋体)、(2.13) 吡唑萘菌胺 (反式差向异构对映体 1R, 4S, 9S)、(2.14) 吡唑萘菌胺 (反式差向异构对映体 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 (顺式差向异构对映体 1R, 4S, 9R)、(2.17) 吡唑萘菌胺 (顺式差向异构对映体 1S, 4R, 9S)、(2.18) 灭锈胺 (mepronil)、(2.19) 氧化萎锈灵 (oxycarboxin)、(2.20) 戊苯吡菌胺 (penflufen)、(2.21) 吡噻菌胺 (penthioopyrad)、(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、(2.25) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.26) 3-(二氟甲基)-N-[4-氟-2-(1,1,2,3,3,3-六氟丙氧基)苯基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.27) N-[1-(2,4-二氯苯基)-1-甲氧基丙-2-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.28) 5,8-二氟-N-[2-(2-氟-4-{[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]氧基}苯基)乙基]喹唑啉-4-胺、(2.29) 苯并烯氟菌唑 (benzovindiflupyr)、(2.30) N-[(1S, 4R)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-甲醇萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、和 (2.31) N-[(1R, 4S)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-甲醇萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.32) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.33) 1,3,5-三甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.34) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.35) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.36) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.37) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.38) 3-(二氟甲基)-1-甲

基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.39)1,3,5-三甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.40)1,3,5-三甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.41)麦锈灵(benodanil)、(2.42)2-氯-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)吡啶-3-甲酰胺、(2.43)isofetamid。

[0458] (3) 作用于呼吸链复合物-III的呼吸抑制剂(呼吸链抑制剂),例如,(3.1)唑嘧菌胺(ametoctradin)、(3.2)吡唑磺菌胺(amisulbrom)、(3.3)嘧菌酯(azoxystrobin)、(3.4)氰霜唑(cyazofamid)、(3.5)甲香菌酯(coumethoxystrobin)、(3.6)丁香菌酯(coumoxystrobin)、(3.7)醚菌胺(dimoxystrobin)、(3.8)烯肟菌酯(enestroburin)、(3.9)噁唑菌酮(famoxadone)、(3.10)咪唑菌酮(fenamidone)、(3.11)氟菌螨酯(flufenoxystrobin)、(3.12)氟嘧菌酯(fluxastrobin)、(3.13)亚胺菌(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-氟嘧啶-4-基]氧基]苯基)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、(3.24)(2E)-2-(甲氧基亚胺)-N-甲基-2-(2-[[{(1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基}胺基]氧基]甲基]苯基)乙酰胺、(3.25)(2E)-2-(甲氧基亚胺)-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-苯基乙烯基]氧基]苯基)亚乙基]氨基]氧基]甲基]苯基)-2-(甲氧基亚胺)-N-甲基乙酰胺、(3.27)(2E)-2-[2-[[{(2E,3E)-4-(2,6-二氯苯基)丁-3-烯-2-基亚基]氨基]氧基]甲基]苯基)-2-(甲氧基亚胺)-N-甲基乙酰胺、(3.28)2-氯-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)吡啶-3-甲酰胺、(3.29)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、(3.30)(2E)-2-[2-[[{(环丙基[(4-甲氧基苯基)亚胺]甲基]硫烷基)甲基]苯基]-3-甲氧基丙-2-烯酸甲酯、(3.31)N-(3-乙基-3,5,5-三甲基环己基)-3-(甲酰基氨基)-2-羟基苯甲酰胺、(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。

[0459] (4) 有丝分裂和细胞分裂抑制剂,例如(4.1)苯菌灵(benomyl)、(4.2)多菌灵(carbendazim)、(4.3)氯苯咪唑(chlorfenazole)、(4.4)乙霉威(diethofencarb)、(4.5)噻唑菌胺(ethaboxam)、(4.6)氟吡菌胺(flupicolid)、(4.7)麦穗宁(fuberidazole)、(4.8)戊菌隆(pencycuron)、(4.9)噻苯咪唑(thiabendazole)、(4.10)甲基硫菌灵(thiophanate-methyl)、(4.11)硫菌灵(thiophanate)、(4.12)苯酰菌胺(zoxamide)、(4.13)5-氯-7-(4-甲基哌啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑[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。

[0460] (5) 具有多位点活性的化合物,例如,(5.1)波尔多液混合物(bordeaux mixture)、(5.2)敌菌丹(captafol)、(5.3)克菌丹(captan)、(5.4)百菌清(chlorothalonil)、(5.5)铜制剂,如氢氧化铜、(5.6)环烷酸铜(copper naphthenate)、(5.7)氧化铜、(5.8)氯氧化铜(copper oxychloride)、(5.9)硫酸铜(copper sulfate)、

(5.10) 抑菌灵 (dichlofluanid)、(5.11) 二噻农 (dithianon)、(5.12) 多果定 (dodine)、(5.13) 多果定游离碱 (dodinefree base)、(5.14) 福美铁 (ferbam)、(5.15) N-邻苯二甲酰亚胺 (fluorofolpet)、(5.16) 灭菌丹 (folpet)、(5.17) 双胍盐 (guazatine)、(5.18) 双胍辛乙酸盐 (guazatine acetate)、(5.19) 双胍辛胺 (iminooctadine)、(5.20) 双胍辛胺苯磺酸盐 (iminooctadine albesilate)、(5.21) 双胍辛胺三乙酸盐 (iminooctadine 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 (zinc metiram)、(5.27) 喹啉铜 (copper-oxine)、(5.28) 丙烷脒 (propamidine)、(5.29) 甲基代森锌 (propineb)、(5.30) 硫和硫制剂,如多硫化钙、(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) 和 (5.35) 敌菌灵 (anilazine)。

[0461] (6) 抗性诱导剂,例如,(6.1) 苯并噻二唑 (acibenzolar-S-methyl)、(6.2) 异噻菌胺 (isotianil)、(6.3) 烯丙苯噻唑 (probenazole)、(6.4) 噻酰菌胺 (tiadinil) 和 (6.5) 海带多糖 (laminarin)。

[0462] (7) 氨基酸和蛋白质生物合成抑制剂,例如,(7.1) 胺扑灭 (andoprim)、(7.2) 灭瘟素 (blasticidin-S)、(7.3) 环丙嘧啶 (cyprodinil)、(7.4) 春雷霉素 (kasugamycin)、(7.5) 春雷霉素盐酸盐水合物 (kasugamycin hydrochloride hydrate)、(7.6) 嘧菌胺 (mepanipyrim)、(7.7) 嘧霉胺 (pyrimethanil)、(7.8) 3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基) 喹啉和 (7.9) 土霉素 (oxytetracycline) 和 (7.10) 链霉素 (streptomycin)。

[0463] (8) ATP 生成抑制剂,例如,(8.1) 三苯基乙酸锡 (fentin acetate)、(8.2) 三苯基氯化锡 (fentin chloride)、(8.3) 三苯基氢氧化锡 (fentin hydroxide)、(8.4) 硅噻菌胺 (silthiofam)。

[0464] (9) 细胞壁合成抑制剂,例如 (9.1) 苯噻菌胺 (benthiavalicarb)、(9.2) 烯酰吗啉 (dimethomorph)、(9.3) 氟吗啉 (flumorph)、(9.4) 异丙菌胺 (iprovalicarb)、(9.5) 双炔酰菌胺 (mandipropamid)、(9.6) 多抗霉素 (polyoxins)、(9.7) 保粒霉素 (polyoxorim)、(9.8) 有效霉素 A (validamycin A)、(9.9) 霜霉灭 (valifenalate) 和 (9.10) 多氧菌素 B (polyoxin B)。

[0465] (10) 脂类和膜合成抑制剂,例如,(10.1) 联苯、(10.2) 地茂散 (chloroneb)、(10.3) 氯硝胺 (dicloran)、(10.4) 克瘟散 (edifenphos)、(10.5) 土菌灵 (etr Diazole)、(10.6) 依杜卡 (iodocarb)、(10.7) 异稻瘟净 (iprobenfos)、(10.8) 稻瘟灵 (isoprothiolane)、(10.9) 霜霉威 (propamocarb)、(10.10) 霜霉威盐酸盐 (propamocarb hydrochloride)、(10.11) 胺丙威 (prothiocarb)、(10.12) 定菌磷 (pyrazophos)、(10.13) 五氯硝基苯 (quintozene)、(10.14) 四氧硝基苯 (tecnazene) 和 (10.15) 甲基立枯磷 (tolclofos-methyl)。

[0466] (11) 黑色素生物合成抑制剂,例如 (11.1) 环丙酰菌胺 (carpropamid)、(11.2) 双氯氰菌胺 (diclocymet)、(11.3) 稻瘟酰胺 (fenoxanil)、(11.4) 四氯苯酞 (fthalide)、(11.5) 咯嗪酮 (pyroquilon)、(11.6) 三环唑 (tricyclazole)、(11.7) 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；

[0467] (12) 核酸合成抑制剂,例如,(12.1) 苯霜灵 (benalaxyl)、(12.2) 高效苯霜灵

(benalaxyl-M) ((kiralaxyl)、(12.3) 乙嘧酚磺酸酯 (bupirimate)、(12.4) clozylacon、(12.5) 甲菌定 (dimethirimol)、(12.6) 乙菌定 (ethirimol)、(12.7) 呋霜灵 (furalaxyl)、(12.8) 噁霉灵 (hymexazol)、(12.9) 甲霜灵 (metalaxyl)、(12.10) 高效甲霜灵 (metalaxyl-M) (mefenoxam)、(12.11) 甲呋酰胺 (ofurace)、(12.12) 噁霜灵 (oxadixyl)、(12.13) 噁唑酸 (oxolinic acid) 和 (12.14) 辛噻酮 (octhilinone)。

[0468] (13) 信号转导抑制剂, 例如, (13.1) 乙菌利 (chlozolate)、(13.2) 拌种咯 (fenpiclonil)、(13.3) 咯菌腈 (fludioxonil)、(13.4) 异菌脲 (iprodione)、(13.5) 腐霉利 (procymidone)、(13.6) 喹氧灵 (quinoxifen)、(13.7) 乙烯菌核利 (vinclozolin) 和 (13.8) 丙氧喹啉 (proquinazid) ;

[0469] (14) 解偶联剂, 例如, (14.1) 乐杀螨 (binapacryl)、(14.2) 敌螨普 (dinocap)、(14.3) 噻菌脲 (ferimzone)、(14.4) 氟啶胺 (fluazinam) 和 (14.5) 消螨多 (meptyldinocap)。

[0470] (15) 其他化合物, 例如 (15.1) 苯噻硫氰 (benthiazole)、(15.2) bethoxazine、(15.3) 卡巴西霉素 (capsimycin)、(15.4) 香芹酮 (carvone)、(15.5) 灭螨猛 (chinomethionat)、(15.6) 甲氧苯啉菌 (pyriofenone) (氯芬酮 (chlazafenone))、(15.7) 硫杂灵 (cufraneb)、(15.8) 环氟菌胺 (cyflufenamid)、(15.9) 霜脲氰 (cymoxanil)、(15.10) 环丙磺酰胺 (cyprosulfamide)、(15.11) 棉隆原粉 (dazomet)、(15.12) 咪菌威 (debacarb)、(15.13) 双氯酚 (dichlorophen)、(15.14) 哒菌酮 (diclomezine)、(15.15) 野燕枯 (difenzoquat)、(15.16) 野燕枯甲基硫酸盐 (difenzoquat methylsulphate)、(15.17) 二苯胺 (diphenylamine)、(15.18) EcoMate、(15.19) 胺苯吡菌酮 (fenpyrazamine)、(15.20) 氟联苯菌 (flumetover)、(15.21) 唑呋草 (fluoromid)、(15.22) 磺菌胺 (flusulfamide)、(15.23) 氟噻菌灵 (flutianil)、(15.24) 三乙膦酸铝 (fosetyl-aluminium)、(15.25) 三乙膦酸钙 (fosetyl-calcium)、(15.26) 三乙膦酸钠 (fosetyl-sodium)、(15.27) 六氯苯 (hexachlorobenzene)、(15.28) 人间霉素 (irumamycin)、(15.29) 磺菌威 (methasulfocarb)、(15.30) 异硫氰酸甲酯 (methyl isothiocyanate)、(15.31) 苯菌酮 (metrafenone)、(15.32) 灭粉霉素 (mildiomycin)、(15.33) 游霉素 (natamycin)、(15.34) 二甲基二硫代氨基甲酸镍 (nickel dimethyldithiocarbamate)、(15.35) 酞菌酯 (nitrothal-isopropyl)、(15.36) 辛噻酮 (octhilinone)、(15.37) oxamocarb、(15.38) 奥施康定 (oxyfenthiin)、(15.39) 五氯苯酚 (pentachlorophenol) 及其盐、(15.40) 苯醚菊酯 (phenothrin)、(15.41) 磷酸及其盐、(15.42) 霜霉威-乙膦酸盐 (propamocarb-fosetylalte)、(15.43) 丙醇菌素钠 (propanosine-sodium)、(15.44) 丁吡吗啉 (pyrimorph)、(15.45) (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、(15.46) (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、(15.47) 吡咯菌素 (pyrrolnitrin)、(15.48) 特弗喹啉 (tebufloquin)、(15.49) 叶枯酞 (tecloftalam)、(15.50) 甲磺菌胺 (tolnifanide)、(15.51) 咪唑啉 (triazoxide)、(15.52) 水杨菌胺 (trichlamide)、(15.53) 氰菌胺 (zarilamid)、(15.54) (3S, 6S, 7R, 8R)-8-苄基-3-[(3-[(异丁酰氧基) 甲氧基]-4-甲氧基吡啶-2-基} 羰基) 氨基]-6-甲基-4, 9-二氧代-1, 5-二氧杂环壬烷-7-基-2-甲基丙酸酯、(15.55) 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、(15.56)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、(15.57)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、(15.58)1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁烷-2-基-1H-咪唑-1-羧酸酯、(15.59)2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺酰基)吡啶、(15.60)2,3-二丁基-6-氯噻吩并[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮、(15.61)2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二硫杂[2,3-c:5,6-c']二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮、(15.62)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、(15.63)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、(15.64)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、(15.65)2-丁氧基-6-碘代-3-丙基-4H-苯并吡喃-4-酮、(15.66)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、(15.67)2-苯基苯酚及其盐、(15.68)3-(4,4,5-三氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉、(15.69)3,4,5-三氯吡啶-2,6-二甲腈、(15.70)3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基哒嗪、(15.71)4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基哒嗪、(15.72)5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇、(15.73)5-氯-N'-苯基-N'-(丙-2-炔-1-基)噻吩-2-磺酰肼、(15.74)5-氟-2-[(4-氟苄基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.75)5-氟-2-[(4-甲基苄基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.76)5-甲基-6-辛基[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-7-胺、(15.77)(2Z)-3-氨基-2-氰基-3-苯基丙烯酸乙酯、(15.78)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-甲基酰亚胺基甲酰胺、(15.79)N-(4-氯苄基)-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]丙酰胺、(15.80)N-[4-氯苄基](氰基)甲基]-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]丙酰胺、(15.81)N-[5-溴-3-氯吡啶-2-基]甲基]-2,4-二氯烟酰胺、(15.82)N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯烟酰胺、(15.83)N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2-氟-4-碘烟酰胺、(15.84)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、(15.85)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、(15.86)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-甲基酰亚胺基甲酰胺、(15.87)N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-(1,2,3,4-四氢化萘-1-基)-1,3-噻唑-4-甲酰胺、(15.88)N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-(1R)-1,2,3,4-四氢化萘-1-基]-1,3-噻唑-4-甲酰胺、(15.89)N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-(1S)-1,2,3,4-四氢化萘-1-基]-1,3-噻唑-4-甲酰胺、(15.90){6-[(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基}氧基]甲基]吡啶-2-基}氮

基甲酸戊酯、(15.91) 吩嗪-1-羧酸、(15.92) 喹啉-8-醇、(15.93) 喹啉-8-醇硫酸盐 (2:1)、(15.94) {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、(15.95) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[2'-(三氟甲基)二苯基-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.96) N-(4'-氯二苯基-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.97) N-(2',4'-二氯二苯基-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.98) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(三氟甲基)二苯基-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.99) N-(2',5'-二氟二苯基-2-基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.100) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)二苯基-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.101) 5-氟-1,3-二甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)二苯基-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.102) 2-氯-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)二苯基-2-基]烟酰胺、(15.103) 3-(二氟甲基)-N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)二苯基-2-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.104) N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)二苯基-2-基]-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.105) 3-(二氟甲基)-N-(4'-乙炔基二苯基-2-基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.106) N-(4'-乙炔基二苯基-2-基)-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.107) 2-氯-N-(4'-乙炔基二苯基-2-基)烟酰胺、(15.108) 2-氯-N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)二苯基-2-基]烟酰胺、(15.109) 4-(二氟甲基)-2-甲基-N-[4'-(三氟甲基)二苯基-2-基]-1,3-噻唑-5-甲酰胺、(15.110) 5-氟-N-[4'-(3-羟基-3-甲基丁-1-炔-1-基)二苯基-2-基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.111) 2-氯-N-[4'-(3-羟基-3-甲基丁-1-炔-1-基)二苯基-2-基]烟酰胺、(15.112) 3-(二氟甲基)-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)二苯基-2-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.113) 5-氟-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)二苯基-2-基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.114) 2-氯-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)二苯基-2-基]烟酰胺、(15.115) (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、(15.116) 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、(15.117) 4-氧代-4-[(2-苯基乙基)氨基]丁酸、(15.118) {6-[(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基}氧基]甲基]吡啶-2-基}氨基甲酸丁-3-炔-1-基酯、(15.119) 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)、(15.120) 3,4,5-三羟基苯甲酸丙酯、(15.121) 1,3-二甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.122) 1,3-二甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.123) 1,3-二甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.124) [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、(15.125) (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、(15.126) (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、(15.127) 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、(15.128) 硫氰酸 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-基酯、(15.129) 5-(烯丙基硫烷

基)-1-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(15.130)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、(15.131)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、(15.132)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、(15.133)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、(15.134)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、(15.135)5-(烯丙基硫烷基)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(15.136)5-(烯丙基硫烷基)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(15.137)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、(15.138)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、(15.139)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、(15.140)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、(15.141)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、(15.142)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、(15.143)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、(15.144)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、(15.145)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、(15.146)2-(6-苄基吡啶-2-基)喹啉、(15.147)2-[6-(3-氟-4-甲氧基苯基)-5-甲基吡啶-2-基]喹啉、(15.148)3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉、(15.149)脱落酸(abscisic acid)、(15.150)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-吡啶-4-甲酰胺、(15.151)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-甲基酰亚胺基甲酰胺、(15.152)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-甲基酰亚胺基甲酰胺、(15.153)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-甲基酰亚胺基甲酰胺、(15.154)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-甲基酰亚胺基甲酰胺、(15.155)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-甲基酰亚胺基甲酰胺、(15.156)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-甲基酰亚胺基甲酰胺、(15.157)N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(15.158)N-环丙基-N-(2-环丙基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(15.159)N-(2-叔-丁

基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.160) N-(5-氯-2-乙基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.161) N-(5-氯-2-异丙基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.162) 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-甲酰胺、(15.163) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(5-氟-2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.164) N-环丙基-N-(2-环丙基-5-氟苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.165) N-(2-环戊基-5-氟苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.166) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-氟-6-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.167) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.168) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基-5-甲基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.169) N-环丙基-N-(2-环丙基-5-甲基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.170) N-(2-叔-丁基-5-甲基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.171) N-[5-氯-2-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.172) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-N-[5-甲基-2-(三氟甲基)苄基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.173) N-[2-氯-6-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.174) N-[3-氯-2-氟-6-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.175) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-4,5-二甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.176) 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、(15.177) 3-(二氟甲基)-N-(7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茚-4-基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.178) 3-(二氟甲基)-N-[(3R)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茚-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.179) 3-(二氟甲基)-N-[(3S)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茚-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.180) N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基苄基)-N-乙基-N-甲基酰亚胺基甲酰胺、(15.181) N'-{4-[(4,5-二氯-1,3-噻唑-2-基)氧基]-2,5-二甲基苄基}-N-乙基-N-甲基酰亚胺基甲酰胺、(15.182) N-(4-氯-2,6-二氟苄基)-4-(2-氯-4-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺。视情况而定, (1) 至 (15) 类提及的所有混合组分可以与合适的碱或酸形成盐, 如果它们在其官能团的基础上能够如此的话。

[0471] 作为混合组分的生物农药

[0472] 式 (I) 的化合物可与生物农药结合。

[0473] 生物农药尤其包括细菌、真菌、酵母、植物提取物和微生物产生的产物, 包括蛋白质和次级代谢物。

[0474] 生物农药包括细菌如形成孢子细菌 (spore-forming bacteria)、根拓殖细菌 (root-colonizing bacteria) 和能充当生物杀昆虫剂、杀真菌剂或杀线虫剂的细菌。

[0475] 用作或可用作生物农药的这类细菌的实例为:

[0476] 解淀粉芽孢杆菌 (*Bacillus amyloliquefaciens*)、菌株 FZB42 (DSM 231179);

或蜡样芽孢杆菌 (*Bacillus cereus*), 尤其是蜡样芽孢杆菌 (*B. cereus*) 菌株 CNCM I-1562 或者坚强芽孢杆菌 (*Bacillus firmus*), 菌株 I-1582(登录号 CNCMI-1582), 或短小芽孢杆菌 (*Bacillus pumilus*), 尤其是菌株 GB34(登录号 ATCC 700814) 和菌株 QST2808(登录号 NRRL B-30087); 或枯草芽孢杆菌 (*Bacillus subtilis*), 尤其是菌株 GB03(登录号 No. ATCC SD-1397)、或枯草芽孢杆菌菌株 QST713(登录号 NRRL B-21661) 或枯草芽孢杆菌菌株 OST 30002(登录号 NRRL B-50421); 苏云金芽孢杆菌 (*Bacillus thuringiensis*), 尤其是苏云金芽孢杆菌以色列亚种 (*B. thuringiensis* subspecies *israelensis*) (血清型 H-14), 菌株 AM65-52(登录号 ATCC 1276), 或苏云金芽孢杆菌鲎泽亚种 (*B. thuringiensis* subsp. *aizawai*), 尤其是菌株 ABTS-1857(SD-1372), 或苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种 (*B. thuringiensis* subsp. *Kurstaki*) 菌株 HD-1, 或苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种 (*thuringiensis* subsp. *tenebrionis*) 菌株 NB 176(SD-5428); 穿刺巴斯德氏柄菌 (*Pasteuria penetrans*), 巴斯德芽菌属种 (*Pasteuria* spp.) (肾形肾状线虫 (*Rotylenchulus reniformis* nematode))-PR3(登录号 ATCC SD-5834); 细黄链霉菌 (*Streptomyces microflavus*) 菌株 AQ6121(= QRD 31. 013, NRRL B-50550); 鲜黄链霉菌 (*Streptomyces galbus*) 菌株 AQ 6047(登录号 NRRL 30232)。

[0477] 用作或可用作生物农药的真菌和酵母菌的实例为:

[0478] 球孢白僵菌 (*Beauveria bassiana*), 尤其是菌株 ATCC 74040; 盾壳霉 (*Coniothyrium minitans*), 尤其是菌株 CON/M/91-8(登录号 DSM-9660); 刀孢蜡蚧菌属种 (*Lecanicillium* spp.), 尤其是菌株 HRO LEC 12; 蜡蚧霉 (*Lecanicillium lecanii*), (原名为蜡蚧轮枝菌 (*Verticillium lecanii*)), 尤其是菌株 KV01; 绿僵菌 (*Metarhizium anisopliae*), 尤其是菌株 F52(DSM3884/ATCC 90448); 梅奇酵母菌 (*Metschnikowia fructicola*), 尤其是菌株 NRRL Y-30752; 玫烟色拟青霉 (*Paecilomyces fumosoroseus*) (现名: 玫烟色棒束孢 (*Isaria fumosorosea*)), 尤其是菌株 IFPC 200613, 或菌株阿波普卡 (*Apopka*) 97(登录号 ATCC 20874); 淡紫拟青霉 (*Paecilomyces lilacinus*), 尤其是淡紫拟青霉 (*P. lilacinus*) 菌株 251(AGAL 89/030550); 黄色蠕形霉 (*Talaromyces flavus*), 尤其是菌株 V117b; 深绿木霉 (*Trichoderma atroviride*), 尤其是菌株 SC1(登录号 CBS 122089); 哈茨木霉 (*Trichoderma harzianum*), 尤其是哈茨木霉 (*T. harzianum* rifai) T39(登录号 CNCM I-952)。

[0479] 用作或可用作生物农药的病毒的实例为:

[0480] 棉褐带卷蛾 (*Adoxophyes orana*) (夏季水果小卷蛾 (*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*) (美国棉树叶虫 (*African cotton leafworm*)) NPV。

[0481] 还包括作为“接种剂”添加到植物或植物部位或植物器官中的细菌和真菌, 这些细菌和真菌通过其特殊性能促进植物生长和植物健康。实例包括:

[0482] 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.) (以

前称为洋葱假单孢菌 (*Pseudomonas cepacia*)、巨孢囊霉属种 (*Gigaspora* spp.)、或单包巨孢囊霉属 (*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*)、假单孢菌属种 (*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.)。

[0483] 用作或可用作生物农药的植物提取物和微生物产生的产物，包括蛋白质和次级代谢物的实例为：

[0484] 大蒜 (*Allium sativum*)、苦艾 (*Artemisia absinthium*)、印苦楝子素 (azadirachtin)、Biokeeper WP、Cassia nigricans、苦皮藤 (*Celastrus angulatus*)、美洲土荆芥 (*Chenopodium anthelminticum*)、几丁质 (chitin)、Armour-Zen、绵马 (*Dryopteris filix-mas*)、马尾草 (*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 (*Quercus*)、皂树 (*Quillaja*)、Regalia、“Requiem™ 杀昆虫剂”、鱼藤酮 (rotenone)、鱼尼丁/雷诺定 (ryania/ryanodine)、西门肺草 (*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)、桑寄生 (*Viscum album*)、十字花科 (Brassicaceae) 提取物，尤其是油菜籽粉或芥末粉。

[0485] 作为混合组分的安全剂

[0486] 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)、解草酯 (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 (fencloirim)、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 (CAS 129531-12-0)、4-(二氯乙酰基)-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷 (CAS 71526-07-3)、2,2,5-三甲基-3-(二氯乙酰基)-1,3-噁唑烷 (CAS 52836-31-4)。

[0487] 植物和植物部位

[0488] 所有的植物和植物部位均可根据本发明进行处理。本文中植物应理解为意指所有植物和植物种群，例如期望和不期望的野生植物或作物植物（包括天然存在的作物植物），例如谷类（小麦、水稻、黑小麦、大麦、黑麦、燕麦）、玉米、大豆、土豆、糖用甜菜、甘蔗、番茄、豌豆和其他蔬菜物种、棉花、烟草、油菜以及果实植物（具有以下果实：苹果、豌豆、柑橘类果实和葡萄）。作物植物可以为通过常规的育种和优化方法或者通过生物技术方法或基因工程方法或这些方法的组合获得的植物，包括转基因植物以及包括可受或不受植物育种者的权益 (plant breeders' right) 保护的植物栽培种。植物部位应当理解为意指植物的所有地上和地下的部位和器官，如芽、叶、花和根，给出的实例为叶、针叶、茎、干、花、子实体、果实和种子、以及块茎、根和根茎。植物部位还包括采收材料以及无性和有性繁殖材料，例如插枝、块茎、根茎、分株 (slip) 和种子。

[0489] 本发明的利用式 (I) 的化合物对植物和植物部位进行的处理通过常规处理方法直接进行或通过使所述化合物作用于其环境、生境或储存空间来进行,所述常规处理方法例如浸渍、喷雾、蒸发、雾化、散布、喷涂、注射,以及在繁殖材料的情况下,尤其是种子的情况下,还可施用一层或多层包衣。

[0490] 如上所述,可根据本发明处理所有植物及其部位。在一个优选的实施方案中,处理野生植物物种和植物栽培种,或通过常规生物育种如杂交或原生质体融合获得的那些及其部位。在另一优选的实施方案中,处理通过基因工程——如果合适可与常规方法结合——获得的转基因植物和植物栽培种(基因修饰生物体)及其部位。术语“部位”或“植物的部位”或“植物部位”已在上文中进行解释。根据本发明,特别优选分别处理的市售常规栽培种或正在使用中的那些植物。植物栽培种应理解为意指通过常规育种、突变或重组 DNA 技术获得的具有新特性(“特征”)的植物。它们可以是栽培种、变种、生物型或基因型。

[0491] 转基因植物、种子处理和整合株系(integration events)

[0492] 根据本发明处理的优选的转基因植物或植物栽培种(通过基因工程获得的那些)包括通过基因修饰、接受遗传材料的所有植物,该遗传材料能赋予这些植物特别有利的有用特性(“特征”)。这种特性的实例为:更好的植物生长、对高温或低温增强的耐受性、对干旱或对水的水平或土壤盐度增强的耐受性、提高的开花性能、更容易采收、加速成熟、更高的产量、采收产品的更高的品质和/或更高的营养价值、采收产品的更长的储存寿命和/或可加工性。这种特性的其他和特别强调的实例为,增强植物对动物害虫和微生物害虫的抗性,例如抵抗昆虫、蛛形纲动物、线虫、螨虫、蛞蝓以及蜗牛,例如,这是由于植物中形成的毒素、特别是通过来自苏云金芽孢杆菌的遗传材料(例如通过基因 CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c Cry2Ab、Cry3Bb 和 CryIF 及其组合)在植物中形成的那些毒素;以及增强植物对植物病原性真菌、细菌和/或病毒的抗性,该抗性由例如是通过系统获得性抗性(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的;以及提高植物对特定除草活性成分,例如咪唑啉酮类、磺酰脲类、草甘膦或草丁膦(例如“PAT”基因)的耐受性。赋予所述所需特性(“特征”)的基因可在转基因植物中以与互相结合的形式存在。转基因植物的实例包括重要的作物植物,例如谷类(小麦、水稻、黑小麦、大麦、黑麦、燕麦)、玉米、大豆、马铃薯、糖用甜菜、甘蔗、番茄、豌豆和其他类型的蔬菜、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、水稻、马铃薯、棉花、糖用甘蔗、烟草和油菜。特别强调的特性(“特征”)是增强植物对昆虫、蛛形纲动物、线虫以及蛞蝓和蜗牛的抗性。

[0493] 作物保护——处理的类型

[0494] 利用式 (I) 的化合物对植物和植物部位的处理利用常规处理方法直接进行,或作用于其环境、生境或储存空间来进行,所述常规处理方法例如浸渍、喷洒、喷雾、灌溉、蒸发、喷粉、雾化、撒播、发泡、喷涂、铺展、注射、浇水(浸透)、滴灌,在繁殖材料的情况下,尤其是种子的情况下,还可通过结壳、用一层或多层包衣包覆等方法作为粉末用于干种子处理、作为溶液用于液体种子处理、作为水溶性粉末用于悬浮液处理。还可利用超低量方法施用式 (I) 的化合物或者将其施用形式或式 (I) 化合物本身注射到土壤中。

[0495] 植物的优选的直接处理为叶面施用,即将式 (I) 的化合物施用到叶子上,其中处理频率和施用率应根据所述害虫的侵袭水平来调整。

[0496] 在内吸性活性化合物的情况下,式(I)的化合物还可以经由根系进入植物。然后,该植物通过将式(I)的化合物作用于植物的生境来处理。这可以通过例如以下方式完成:浸透;或者混入土壤或营养液中,这意味着植物位点(例如土壤或水培系统)充满液体形式的式(I)的化合物;或土壤施用,这意味着将式(I)的化合物以固体形式(例如以颗粒的形式)引入到植物位点。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形式(例如作为颗粒)计量加入淹没的稻田来完成。

[0497] 种子处理

[0498] 通过对植物种子进行处理来防治动物害虫早已已知,并且是不断改进的主题。然而,种子处理产生一系列总是不能以令人满意的方式解决的问题。因此,需要开发用于保护种子和发芽作物的方法,所述方法不需要或至少显著降低在储存过程中、在播种后或植物出苗后农药的额外施用。还需要优化所使用的活性成分的量,以便为种子和发芽植物提供最佳的保护以免于动物害虫的侵袭,而所使用的活性成分不会损害植物本身。特别地,用于种子处理的方法还应考虑到害虫抗性或害虫耐受性转基因植物的固有的杀昆虫和/或杀线虫特性,以便以农药的最少使用量获得对种子和发芽植物的最佳保护。

[0499] 因此,本发明还特别涉及一种通过用一种式(I)的化合物处理种子来保护种子和发芽植物免受害虫侵袭的方法。用于保护种子和发芽植物免受害虫侵袭的本发明方法还包括这样一种方法,其中在一个操作中或连续地用式(I)的化合物和混合组分同时处理种子。其还包括在不同的时间用式(I)的化合物和混合组分处理种子的方法。

[0500] 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。

[0501] 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的情况下,各成分可存在于该种子的不同层。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。本发明还涉及种子,其中已经施用了作为包衣的一部分或其他层或除了包衣外的其他层的式(I)的化合物和混合组分。

[0502] 本发明还涉及种子,其在用式(I)的化合物处理后,经过薄膜包覆过程以避免该种子免受灰尘磨损。

[0503] 当式(I)的一种化合物内吸性地作用时,其优势之一在于,种子的处理不仅保护种子本身还保护由其(出苗后)得到的植物免受动物害虫的侵袭。以这种方式,可免除在播种时或在其后不久对作物进行的直接处理。

[0504] 另一优势在于,用式(I)的化合物处理种子可促进经处理的种子发芽和出苗。

[0505] 同样认为有利的是,式(I)的化合物还可特别地用于转基因种子。

[0506] 另外,式(I)的化合物可与信号技术组合物(signalling technology compositions)结合使用,其结果是,使共生体,例如根瘤菌、菌根和/或内生细菌或真菌的集群(colonization)更好,和/或引起固氮作用优化。

[0507] 式(I)的化合物适于保护在农业、温室、林业或园艺中使用的任何植物变种的种子。更特别地,所述种子包括谷物(例如小麦、大麦、黑麦、粟和燕麦)、玉米、棉花、大豆、水稻、马铃薯、向日葵、咖啡豆、烟草、芥花(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、生菜）、果实植物、草坪植物和观赏性植物的种子。特别重要的是处理谷物（小麦、大麦、黑麦、燕麦）、玉米、大豆、棉花、芥花、油菜和水稻的种子。

[0508] 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。所述种子包括通常包含至少一种防治特别是具有杀昆虫和 / 或杀线虫特性的多肽的表达的异源基因的植物的种子。转基因种子中的异源基因可来自微生物如芽孢杆菌属 (*Bacillus*)、根瘤菌属 (*Rhizobium*)、假单孢菌属 (*Pseudomonas*)、沙雷氏菌属 (*Serratia*)、木霉属 (*Trichoderma*)、棒形杆菌属 (*Clavibacter*)、球囊霉属 (*Glomus*) 或粘帚霉属 (*Gliocladium*)。本发明的组合物特别适合用于处理包含至少一种源自芽孢杆菌属的异源基因的转基因种子。所述异源基因更优选源自苏云金芽孢杆菌 (*Bacillus thuringiensis*)。

[0509] 在本发明的上下文中，将式 (I) 的化合物施用于种子。优选在这样的状态下处理种子：其足够稳定以使得在处理过程中不发生损害。一般而言，种子可在采收和播种之间的任意时间点处理。通常使用已从植物分离并且已除去穗轴、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量的种子。或者，还可使用干燥之后例如用水处理（例如灌注），然后再次干燥的种子。在水稻种子的情况下，还可使用例如已在水中预先膨胀至最高达特定阶段（鸡胸阶段 (pigeon breast stage)），从而达到更好的发芽和更均匀的出芽的种子。

[0510] 在处理种子时，通常必须确保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，以使得种子的发芽不会受到不利影响以及所得的植物不会受到损害。特别是在特定施用率下可表现出植物毒害效应的活性成分的情况下，这必须特别保证。

[0511] 通常，式 (I) 的化合物以合适的制剂形式施用于种子。合适的制剂和种子处理方法是本领域技术人员已知的。

[0512] 式 (I) 的化合物可转化为常规拌种制剂，例如溶液剂、乳剂、悬液剂、粉剂、泡沫剂、浆剂或其他用于种子的包衣组合物，以及 ULV 制剂。

[0513] 这些制剂以已知的方式制备，通过将式 (I) 的化合物与常规添加剂混合，所述添加剂例如常规的填充剂和溶剂或稀释剂、着色剂、湿润剂、分散剂、乳化剂、消泡剂、防腐剂、二次增稠剂、粘着剂 (sticker)、赤霉素以及水。

[0514] 可存在于根据本发明使用的拌种制剂中的有用的着色剂为通常用于所述目的的所有着色剂。可以使用微溶于水的颜料，或者可使用可溶于水的染料。实例包括已知的命名为罗丹明 B (Rhodamine B)、C. I. 颜料红 112 和 C. I. 溶剂红 1 的已知着色剂。

[0515] 可存在于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成分制剂的所有物质。优选使用烷基萘磺酸盐，例如二异丙基萘磺酸盐或二异丁基萘磺酸盐。

[0516] 可存在于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中的所有非离子、阴离子和阳离子分散剂。优选使用非离子或阴离子分散剂或者非离子或阴离子分散剂的混合物。合适的非离子分散剂特别包括环氧乙烷 / 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、以及芳基磺酸盐 /

甲醛的缩合物。

[0517] 可存在于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成分制剂中的所有泡沫抑物质。优选使用硅酮消泡剂和硬脂酸镁。

[0518] 可存在于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。实例包括二氯酚和苯甲醇半缩甲醛。

[0519] 可存在于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。

[0520] 可存在于根据本发明使用的拌种制剂中的有用的粘着剂为可在拌种产品中使用的常规粘合剂。优选的实例包括聚乙烯基吡咯烷酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇和甲基纤维素 (tylose)。

[0521] 可存在于根据本发明使用的拌种制剂中的赤霉素优选为赤霉素 A1、A3 (= 赤霉酸)、A4 和 A7 ;特别优选使用赤霉酸。所述赤霉素是已知的 (参见 R. Wegle, “Chemie der Pflanzenschutz-und **Schädlingsbekämpfungsmittel**”, 第 2 卷, Springer Verlag, 1970, 第 401-412 页)。

[0522] 根据本发明使用的拌种制剂可以直接或预先用水稀释后处理多种不同种类种子。例如,可使用浓缩剂或通过用水稀释而由其得到的制剂用于包衣下列种子:谷物(如小麦、大麦、黑麦、燕麦和黑小麦)的种子,以及玉米、水稻、油菜、豌豆、豆、棉花、向日葵、大豆和甜菜的种子,或多种不同的蔬菜种子。根据本发明使用的拌种制剂或其稀释使用形式还可用于拌种转基因植物的种子。

[0523] 对于用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,常规用于种子拌种的所有混合设备均为可用的。更具体地,种子拌种的过程为:将种子分批或连续地置于混合器中;以其本身或预先用水稀释之后,加入特定所需量的拌种制剂;并进行混合直到制剂均匀分布于种子上。如果合适的话,随后可进行干燥操作。

[0524] 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以及种子。式 (I) 的化合物的施用率通常为每千克种子 0.001g 至 50g ;优选每千克种子 0.01g 至 15g。

[0525] 动物健康

[0526] 在动物健康领域,即兽医学领域,式 (I) 的化合物有效地抵抗动物寄生虫,尤其是体外寄生虫或体内寄生虫。术语“体内寄生虫”尤其包括蠕虫和原生动物,如球虫目。体外寄生虫通常且优选为节肢动物,尤其是昆虫或螨虫。

[0527] 在兽医学领域中,具有良好的恒温动物毒性的式 (I) 的化合物适合用于防治寄生虫,其出现在牲畜、育种动物、动物园动物、实验室动物、实验动物和家养动物中的动物育种和动物饲养中。它们有效的抵抗所有或特定发育阶段的寄生虫。

[0528] 农业牲畜包括,例如,哺乳动物,如绵羊、山羊、马、驴、骆驼、水牛、兔、驯鹿、扁角鹿 (fallow deer), 且特别是牛和猪;家禽,如火鸡、鸭、鹅,且特别是鸡;例如水产养殖中的鱼和甲壳类动物;以及昆虫如蜜蜂。

[0529] 家畜动物包括,例如,哺乳动物,如仓鼠、豚鼠、大鼠、小鼠、毛丝鼠、雪貂,特别是狗、猫、笼鸟、爬行动物、两栖动物和观赏鱼。

[0530] 在一个优选的实施方案中,式(I)的化合物给药于哺乳动物。

[0531] 在另一优选的实施方案中,式(I)的化合物给药于禽类,即笼鸟且特别是家禽。

[0532] 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、死亡和性能的降低(在肉、奶、羊毛、生皮、蛋、蜜等情况下)的情况,以使得动物饲养能够更经济和更简单,并且实现更好地保持动物良好的状态。

[0533] 关于动物健康领域,术语“防治(control)”或“防治(controlling)”意指式(I)的化合物在将特定的寄生虫在感染这类寄生虫的动物中的发病率降低至无害程度方面是有效的。更具体而言,在本上下文中,“防治”意指式(I)的化合物能杀死各寄生虫、抑制其生长或抑制其增殖。

[0534] 节肢动物包括:

[0535] 来自虱目(Anoplurida)的节肢动物,例如血虱属种(*Haematopinus* spp.)、毛虱属种(*Linognathus* spp.)、虱属种(*Pediculus* spp.)、阴虱属种(*Phthirus* spp.)、盲虱属种(*Solenopotes* spp.);来自食毛目(Mallophagida)及钝角亚目(Amblycerina)和细角亚目(Ischnocerina)的寄生虫,例如鸟虱属种(*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.)、啮毛虱属种(*Trichodectes* spp.)、猫羽虱属种(*Felicola* spp.);来自双翅目(Diptera)及长角亚目(Nematocerina)和短角亚目(Brachycerina)的寄生虫,例如伊蚊属种(*Aedes* spp.)、按蚊属种(*Anopheles* spp.)、库蚊属种(*Culex* spp.)、蚋属种(*Simulium* spp.)、真蚋属种(*Eusimulium* spp.)、白蛉属种(*Phlebotomus* spp.)、罗蛉属种(*Lutzomyia* spp.)、库蠓属种(*Culicoides* spp.)、斑虻属种(*Chrysops* spp.)、短蚋属种(*Odagmia* spp.)、维蚋属种(*Wilhelmia* spp.)、瘤虻属种(*Hybomitra* spp.)、黄虻属种(*Atylotus* spp.)、虻属种(*Tabanus* spp.)、麻虻属种(*Haematopota* spp.)、*Philipomyia* 属种、蜂虱蝇属种(*Braula* spp.)、家蝇属种(*Musca* spp.)、齿股蝇属种(*Hydrotaea* spp.)、螫蝇属种(*Stomoxys* spp.)、血蝇属种(*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.)、蜱蝇属种(*Melophagus* spp.)、鼻狂蝇属种(*Rhinoestrus* spp.)、大蚊属种(*Tipula* spp.);来自蚤目(Siphonapterida)的寄生虫,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.);

[0536] 来自异翅目(Heteropterida),例如臭虫属种(*Cimex* spp.)、锥猎蝽属种(*Triatoma* spp.)、红猎蝽属(*Rhodnius* spp.)、大锥蝽属(*Panstrongylus* spp.);以及来自蜚蠊目(Blattarida)的有害的卫生害虫。

[0537] 节肢动物还包括:

[0538] 来自蜱螨亚纲(Acari(Acarina))及中气门(Mesostigmata)目的寄生虫,例如来自隐喙蜱科(Argasidae),例如锐缘蜱属种(*Argas* spp.)、钝缘蜱属种(*Ornithodoros* spp.)、残缘蜱属种(*Otobius* spp.);来自硬蜱科,例如硬蜱属种(*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);来自中气门目(*Mesostigmata*),例如皮刺螨属种(*Dermanyssus* spp.)、禽刺螨属种(*Ornithonyssus* spp.)、肺刺螨属种(*Pneumonyssus* spp.)、耳螨属种(*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.);来自辐螨目(*Actinedida*)(前气门亚目(*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.)、*Neotrombicula* 属种、兔牦螨属(*Listrophorus* spp.);来自粉螨目(*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.)、足螨属种(*Chorioptes* spp.)、耳疥螨属种(*Otodectes* spp.)、疥螨属种(*Sarcoptes* spp.)、背肛螨属种(*Notoedres* spp.)、脚螨属种(*Knemidocoptes* spp.)、胞螨属种(*Cytodites* spp.)、鸡雏螨属种(*Laminosioptes* spp.);

[0539] 寄生的原生动物包括:

[0540] 鞭毛纲(*Mastigophora*(*Flagellata*)),例如,来自锥虫科(*Trypanosomatidae*),例如,布鲁斯锥虫(*Trypanosoma* *brucei*)、冈比锥虫(*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*)、杜氏利什曼虫(*L.donovani*)、热带利什曼虫(*L.tropica*),例如毛滴虫科(*Trichomonadidae*),例如肠兰伯氏鞭毛虫(*Giardia lamblia*)、犬属第虫(*G.canis*)。

[0541] 肉鞭毛虫亚门(根足纲)(*Sarcomastigophora*(*Rhizopoda*))例如内阿米巴科(*Entamoebidae*),例如痢疾内阿米巴(*Entamoeba histolytica*)、哈氏虫科(*Hartmannellidae*),例如,棘变形虫属种(*Acanthamoeba* sp.)、哈氏虫属种(*Harmanella* sp.)。

[0542] 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.gallapavonis*)、哈氏艾美虫(*E.hagani*)、肠艾美虫(*E.intestinalis*)、*E.iroquoiana*、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. meleagrititis*)、缓和艾美虫 (*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*)、残余体艾美球虫 (*E. residua*)、粗糙艾美虫 (*E. scabra*)、*E. spec.*、斯氏艾美虫 (*E. stiedai*)、猪艾美虫 (*E. suis*)、禽艾美虫 (*E. tenella*)、树艾美虫 (*E. truncata*)、特鲁特艾美虫 (*E. truttae*)、邱氏艾美虫 (*E. zuernii*)、球虫属种 (*Globidium spec.*)、贝氏等孢子球虫 (*Isospora belli*)、犬等孢子球虫 (*I. canis*)、猫等孢子球虫 (*I. felis*)、俄亥俄等孢子球虫 (*I. ohioensis*)、芮氏等孢子球虫 (*I. rivolta*)、等孢子球虫属种 (*I. spec.*)、猪等孢子球虫 (*I. suis*)、*Cystisospora* 属种、隐孢子虫属种 (*Cryptosporidium spec.*)，特别是小隐孢子虫 (*C. parvum*)；例如弓形虫科 (*Toxoplasmatidae*)，例如刚地弓形虫 (*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. bovi hominis*)、羊犬肉孢子虫 (*S. ovicanis*)、羊猫肉孢子虫 (*S. ovifelis*)、神经肉孢子虫 (*S. neurona*)、肉孢子虫属种 (*S. spec.*)、猪人肉孢子虫 (*S. sui hominis*)，例如 *Leucozoidae*，例如 *Leucozytozoon simondi*，例如疟原虫科 (*Plasmodiidae*)，例如，伯氏疟原虫 (*Plasmodium berghei*)、恶性疟原虫 (*P. falciparum*)、三日疟原虫 (*P. malariae*)、卵形疟原虫 (*P. ovale*)、间日疟原虫 (*P. vivax*)，疟原虫属种 (*P. spec.*)，例如梨质纲 (*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.*)、小泰勒虫 (*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.*)。

[0543] 蠕虫纲 (helminths) 的病原性内寄生虫，包括扁形动物 (platyhelmintha) (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：

[0544] 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.*)

[0545] 绦虫：假叶目 (*Pseudophyllidea*)，例如：裂头绦虫属种 (*Diphyllobothrium spp.*)、迭宫绦虫属种 (*Spirometra spp.*)、头裂畸胎属种 (*Schistocephalus spp.*)、舌状绦虫属种 (*Ligula spp.*)、吸叶绦虫属种 (*Bothridium spp.*)、大复殖孔绦虫属种 (*Diplogonoporus spp.*)

[0546] 圆叶目 (*Cyclophyllidea*)，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.*)、莫尼茨绦虫属种 (*Moniezia spp.*)、遂体绦虫属种 (*Thysanosoma spp.*)、曲子宫绦虫属种 (*Thysaniezia spp.*)、无卵黄腺绦虫属种 (*Avitellina spp.*)、斯泰勒绦虫属种 (*Stilesia spp.*)、锡带绦虫属种 (*Cittotaenia spp.*)、*Andyra* 属种、伯特绦虫属种 (*Bertiella spp.*)、血寄生绦虫属种 (*Taenia spp.*)、棘球绦虫属种 (*Echinococcus spp.*)、泡尾绦虫属种 (*Hydatigera spp.*)、戴维绦虫属种 (*Davainea spp.*)、瑞氏绦虫属种 (*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.)、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.)

[0547] 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.)、东毕血吸虫属种 (*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.)、短咽类吸虫属种 (*Brachylaïma* 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.)、片吸虫属种 (*Fasciola* spp.)、片形吸虫属种 (*Fasciolides* spp.)、姜片虫属种 (*Fasciolopsis* spp.)、环肠吸虫属种 (*Cyclocoelum* spp.)、盲腔吸虫属种 (*Typhlocoelum* spp.)、同盘吸虫属种 (*Paramphistomum* spp.)、杯殖吸虫属种 (*Calicophoron* spp.)、殖盘吸虫属种 (*Cotylophoron* spp.)、巨盘吸虫属种 (*Gigantoctyle* spp.)、菲策吸虫属种 (*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 (*Eurytoma* spp.)、隐孔吸虫属种 (*Troglootrema* 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.)

[0548] 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 (*Eucoleus* spp.)、Trichomosoides属种、旋毛形线虫属种 (*Trichinella* spp.)

[0549] 垫刃目 (Tylenchida), 例如:细丝鲶属种 (*Micronema* spp.)、类圆线虫属种 (*Strongyloides* spp.)

[0550] 小杆亚目 (Rhabditina) 例如:圆线虫属种 (*Strongylus* spp.)、三齿线虫属种 (*Triodontophorus* spp.)、食道齿线虫属种 (*Oesophagodontus* spp.)、毛线线虫属种 (*Trichonema* spp.)、辐首线虫属种 (*Gyaloecephalus* spp.)、柱咽线虫属种 (*Cylindropharynx* spp.)、孟口线虫属种 (*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.)、球头线虫属种 (*Globocephalus* spp.)、比翼线虫属种 (*Syngamus* spp.)、杯口线虫属种 (*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.)、新原线虫属种 (*Neoststrongylus* spp.)、囊尾线虫属种 (*Cystocaulus* spp.)、肺圆线虫属种 (*Pneumoststrongylus* spp.)、尖尾线虫属种 (*Spicocaulus* spp.)、鹿圆线虫属种 (*Elaphoststrongylus* spp.)、副鹿圆线虫属种

(*Parelaphostrongylus* spp.)、环体线虫属种 (*Crenosoma* spp.)、*Paracrenosoma* 属种、奥斯勒线虫属种 (*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.)、古柏线虫属种 (*Cooperia* spp.)、日圆线虫属种 (*Nippostrongylus* spp.)、*Heligmosomoides* 属种、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.)。

[0551] 来自旋尾目 (*Spirurida*)，例如：尖尾线虫属种 (*Oxyuris* spp.)、蛲虫属种 (*Enterobius* spp.)、栓尾线虫属种 (*Passalurus* spp.)、管状线虫属种 (*Syphacia* spp.)、无刺线虫属种 (*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.)、布鲁丝虫属种 (*Brugia* spp.)、吴策线虫属种 (*Wuchereria* spp.)、盘尾丝虫属种 (*Onchocerca* spp.)、旋毛线虫属种 (*Spirocerca* spp.)；

[0552] 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.)；多形目 (*Polymorphida*)，例如：细颈棘头虫属种 (*Filicollis* spp.)；念珠菌 (*Moniliiformida*) 目，例如：念珠棘虫属种 (*Moniliiformis* spp.)，

[0553] 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.)

[0554] 舌形虫 (*Pentastoma*)：蛇舌状虫目 (*Porocephalida*)，例如舌形虫属种 (*Linguatula* spp.)。

[0555] 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、皮肤或鼻腔）给药。给药可以是预防性或治疗性的。

[0556] 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。

[0557] 另一个方面涉及式 (I) 的化合物用作杀内寄生虫剂、尤其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动物畜牧业中、在动物繁育中、在动物圈养中及在卫生领域中用作杀内寄生虫剂、尤其是杀蠕虫剂或抗原生动物剂。

[0558] 另一个方面还涉及式 (I) 的化合物用作杀外寄生虫剂、尤其是杀节肢动物剂（例如，杀昆虫剂或杀螨剂）的用途。另一个方面还涉及式 (I) 的化合物例如在动物畜牧业中、在动物繁育中、在动物圈养中及在卫生领域中用作杀外寄生虫剂，特别是杀节肢动物剂

(例如,杀昆虫剂或杀螨剂)的用途。

[0559] 病媒防治

[0560] 式(I)的化合物还可用于病媒防治。在本发明的上下文中,病媒为节肢动物,尤其是昆虫或蛛形纲动物,其能够将病原体例如病毒、蠕虫、单细胞生物和细菌,从贮主(植物、动物、人等)传染给宿主。病原体可以机械地(例如无刺蝇(non-stinging)的沙眼)传染给宿主,或者可以在注射(例如蚊子的疟原虫)后传染给宿主。

[0561] 病媒以及它们传染的疾病或病原体的实例为:

[0562] 1) 蚊(Mosquitoes)

[0563] - 按蚊属(*Anopheles*):疟疾、丝虫病(filariasis);

[0564] - 库蚊属(*Culex*):日本脑炎(Japanese encephalitis)、丝虫病、其他病毒性疾病、蠕虫传染;

[0565] - 伊蚊属(*Aedes*):黄热病(yellow fever)、登革热(dengue fever)、丝虫病、其他病毒性疾病;

[0566] - 蚋科(*Simuliidae*):蠕虫传染,特别是盘尾丝虫(*Onchocerca volvulus*);

[0567] 2) 虱:皮肤感染、流行性斑疹伤寒(epidemic typhus);

[0568] 3) 跳蚤:鼠疫、地方性斑疹伤寒(endemic typhus);

[0569] 4) 蝇:昏睡病(锥体虫病(trypanosomiasis))、霍乱(cholera)、其他细菌性疾病;

[0570] 5) 螨:壁虱病(acariosis)、流行性斑疹伤寒(epidemic typhus)、立克次氏体痘(rickettsialpox)、土拉菌病(tularaemia)、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);

[0571] 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*))。

[0572] 在本发明的上下文中,病媒的实例为昆虫,例如蚜虫、蝇、叶蝉或蓟马(thrip),其可向植物传播植物病毒。能够传播植物病毒的其他载体是蛛状螨、虱、甲虫和线虫。

[0573] 在本发明的上下文中,病媒的其他实例为昆虫和蛛形纲动物,例如蚊,尤其是伊蚊属、按蚊属的蚊,例如冈比亚按蚊(*A. gambiae*)、阿拉伯按蚊(*A. arabiensis*)、不吉按蚊(*A. funestus*)、大劣按蚊(*A. dirus*)(疟疾);以及库蚊属蚊子、虱、跳蚤、蝇、螨和蜱,其可向动物和/或人类传播病原体。

[0574] 如果式(I)的化合物为耐破坏性的,则病媒防治也是可能的。

[0575] 式(I)的化合物适合用于预防通过病媒传播的疾病和/或病原体。因此,本发明的另一方面为式(I)的化合物在例如农业、园艺、林业、园林以及休闲设备中、以及在材料保护和贮存产品的保护中用于病媒防治的用途。

[0576] 工业材料的保护

[0577] 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,例如来自鞘翅目、膜翅目、等翅目、鳞翅目、啮虫目和衣鱼目的昆虫的侵袭或破坏。

[0578] 在本上下文中,工业材料应理解为意指无生命材料,例如,优选塑料、胶粘剂、胶

料、纸和纸片、皮革、木材及加工的木制品和涂层组合物。特别优选本发明用于保护木材的用途。

[0579] 在另一实施方案中,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。

[0580] 在另一实施方案中,式(I)的化合物为即用型(ready-to-use)农药,即它们不需要其他修饰即可应用到所述材料上。特别地,合适的其他杀昆虫剂或杀真菌剂为上述提及的那些。

[0581] 出人意料的是,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免受污染,特别是船体、筛、网、建筑物、系泊设备及信号系统。同样可以单独使用式(I)的化合物或与其他活性成分结合使用用作防污剂。

[0582] 卫生领域中动物害虫的防治

[0583] 式(I)的化合物适合用于防治卫生领域的动物害虫。更具体而言,本发明可以用于家用领域、卫生领域以及储存产品的保护中,特别是用于防治密闭空间中的昆虫、蛛形纲动物和螨虫,所述密闭空间为例如住所、工厂车间、办公室、车辆客舱。为了防治动物害虫,式(I)的化合物可单独与其他活性成分和/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)的化合物能有效抵抗通常敏感和抗性物种,而且能抵抗所有的发育阶段。

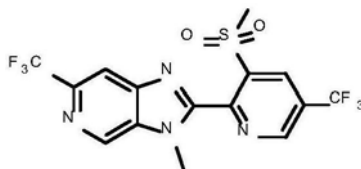
[0584] 这些害虫包括,例如,来自以下的害虫:蛛形纲;蝎目(Scorpiones)、蜘蛛目(Araneae)和盲蛛目(Opiliones);唇足纲和倍足纲;昆虫纲蜚蠊目;鞘翅目、革翅目、双翅目、异翅目、膜翅目、等翅目、鳞翅目、虱目(Phthiraptera)、啮虫目、跳跃目(Saltatoria)或直翅目、蚤目和衣鱼目;软甲纲等足目。

[0585] 在用于铺展的诱饵或诱饵站(bait station)中,作为颗粒剂或粉剂以下列形式施用: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、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(evaporator tablet)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。

[0586] 制备实施例:

[0587] 制备实施例1:3-甲基-2-[3-(甲基磺酰基)-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(I-36)

[0588]

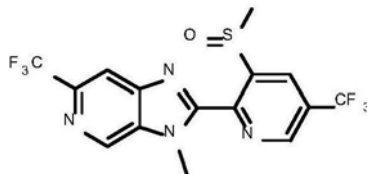


[0589] 将41mg(0.10mmol)的3-甲基-2-[3-(甲基磺烷基)-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶溶解在4ml的二氯甲烷中,在0℃下加入86.5mg(0.36mmol)的间氯过氧苯甲酸,然后将混合物在室温下搅拌20h。将所述混合物与亚硫酸氢钠溶液混合,搅拌10min,用30ml的水稀释,并用45%的氢氧化钠溶液调节pH至9-10。将混合物用二氯甲烷萃取三次,然后在减压下除去结合的有机相中的溶剂。

[0590] ($\log P$ (中性):2.64; MH^+ :425; 1H NMR(400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm:3.70(s, 3H), 3.93(s, 3H), 8.35(s, 1H), 8.83(s, 1H), 9.32(s, 1H), 9.58(s, 1H)。

[0591] 制备 3-甲基-2-[3-(甲基亚磺酰基)-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(I-26)

[0592]

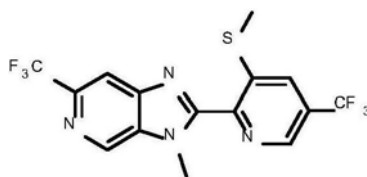


[0593] 将 41mg(0.10mmol) 的 3-甲基-2-[3-(甲基硫烷基)-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶溶于 4ml 的二氯甲烷中,在室温下加入 1.92mg(0.04mmol) 的甲酸和 28.44mg 的 35% 的过氧化氢溶液。将混合物在室温下搅拌 5h,加入亚硫酸氢钠溶液,并且将混合物再搅拌 3h。然后,将混合物与 10% 的碳酸氢钠溶液搅拌混合,除去有机相,将水相用二氯甲烷萃取两次,并且将有机相结合,然后在减压下除去溶剂。

[0594] ($\log P$ (中性):2.76; MH^+ :409; 1H NMR(400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm:3.15(s, 3H), 4.35(s, 3H), 8.37(s, 1H), 8.85(s, 1H), 9.37(s, 1H), 9.39(s, 1H)。

[0595] 制备 3-甲基-2-[3-(甲基硫烷基)-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(I-3)

[0596]

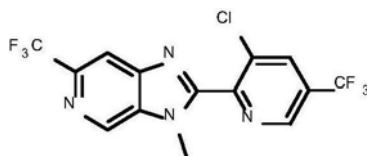


[0597] 在室温下,将 150mg(0.39mmol) 的 2-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶和 83mg(1.18mmol) 的甲硫醇钠在 DMF 中搅拌 6h。将混合物与水混合,并用乙酸乙酯萃取三次。将结合的有机相用氯化钠溶液洗涤、移出、经硫酸钠干燥,并且在减压下除去溶剂。

[0598] ($\log P$ (中性):3.16; MH^+ :393; 1H NMR(400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm:2.58(s, 3H), 4.06(s, 3H), 8.27(s, 1H), 8.32(s, 1H), 8.95(s, 1H), 9.29(s, 1H)。

[0599] 制备 2-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(IX-01)

[0600]



[0601] 在 115℃ 下,将 950mg(4.97mmol) 的 N^3 -甲基-6-(三氟甲基)吡啶-3,4-二胺(II-01)、1.12g(4.97mmol) 的 3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-羧酸和 953mg(4.97mmol) 的 1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳二亚胺盐酸盐(EDCI) 在 10ml 的吡啶中搅拌 7h。在减

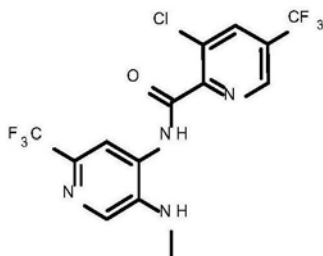
压下除去反应混合物中的溶剂,然后加入水,并将混合物用乙酸乙酯萃取三次。将结合的有机相用硫酸钠干燥,再浓缩,并通过柱层析纯化法通过制备型 HPLC 用作为洗脱液的水 / 乙腈梯度纯化。

[0602] ($\log P$ (中性): 2.96; MH^+ : 381; 1H NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 4.00 (s, 3H), 8.35 (s, 1H), 8.86 (s, 1H), 9.22 (s, 1H), 9.30 (s, 1H)。

[0603] 制备 3-氯-N-[5-(甲基氨基)-2-(三氟甲基)吡啶-4-基]-5-(三氟甲基)吡啶-2-甲酰胺 (VIII-01)

[0604] 通过上述由 N^3 -甲基-6-(三氟甲基)吡啶-3,4-二胺 (II-01) 和 3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-羧酸制备 2-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并 [4,5-c] 吡啶 (IX-01) 的方法,还可制备化合物 (IX-01) 的中间体的化合物 3-氯-N-[5-(甲基氨基)-2-(三氟甲基)吡啶-4-基]-5-(三氟甲基)吡啶-2-甲酰胺 (VIII-01)。

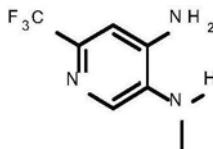
[0605]



[0606] ($\log P$ (中性): 3.09; MH^+ : 399; 1H NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 2.87 (d, 3H), 5.97 (q, 1H), 8.10 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 8.73 (s, 1H), 9.09 (s, 1H), 10.40 (br. S, 1H)。

[0607] 制备 N^3 -甲基-6-(三氟甲基)吡啶-3,4-二胺 (II-01)

[0608]

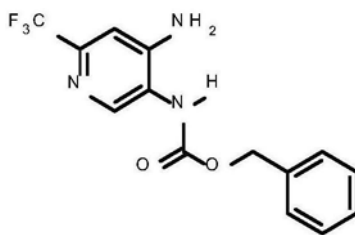


[0609] 将 0.93g (3.0mmol) 的 (4-氨基-6-(三氟甲基)吡啶-3-基)氨基甲酸苄酯于 85ml 的四氢呋喃中的溶液冷却至 0℃,并与 0.65g (17mmol) 的氢化铝锂混合。将混合物在氩气下在 0℃下搅拌 15min,并在室温下搅拌 4h。过量的氢化铝锂通过添加乙酸乙酯除去,将混合物过滤并将滤液每次用 50ml 的 2N 盐酸萃取两次。当冷却时,将结合的盐酸萃取物用碳酸钠调节至 pH = 8。随后,将混合物每次用 100ml 的乙酸乙酯萃取两次,将有机相结合,并用硫酸钠干燥,并且在减压下将溶剂蒸馏出。利用重结晶方法从己烷 / 异丙醇的混合物中进一步纯化产物。

[0610] (MH^+ : 192; 1H NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 2.81 (d, 3H), 5.22 (q, 1H), 5.82 (br. s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.57 (s, 1H)。

[0611] 制备 (4-氨基-6-(三氟甲基)吡啶-3-基)氨基甲酸苄酯

[0612]

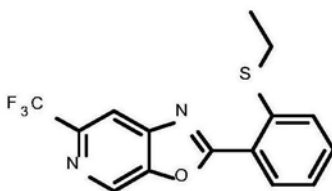


[0613] 将 0.91g 的 6-(三氟甲基)吡啶-3,4-二胺溶解在 20ml 四氢呋喃和 2ml 吡啶的混合物中。在搅拌的同时逐滴加入 1.07g (6.3mmol) 的氯碳酸苄基酯(氯甲酸苄基酯)于 2ml 的四氢呋喃的溶液。然后,将反应混合物搅拌过夜,用 100ml 的水稀释并每次用 100ml 的乙酸乙酯萃取两次。将结合的有机相用 50ml 的水洗涤,经硫酸钠干燥,并浓缩。通过用 50ml 的氯仿洗涤残余物,得到白色固体形式的产物。

[0614] (^1H NMR (500MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 5.15 (s, 2H), 6.40 (br. s, 2H), 7.05 (s, 1H), 7.30–7.45 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 9.00 (br. s, 1H)。

[0615] 制备实施例 2: 2-[2-(乙基硫烷基)苯基]-6-(三氟甲基)[1,3]噁唑并[5,4-c]吡啶 (I-35)

[0616]

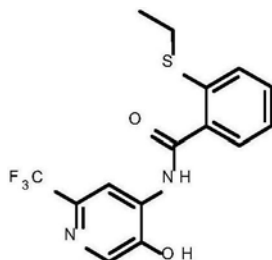


[0617] 将 400mg (1.16mmol) 的 2-(乙基硫烷基)-N-[5-羟基-2-(三氟甲基)吡啶-4-基]苯甲酰胺和 398mg (1.51mmol) 的三苯基膦溶于 12ml THF 中,并且在室温 (RT) 下逐滴加入 661mg (1.51mmol) 的 40% 偶氮二甲酸二乙酯 (DEAD) 于甲苯中的溶液。将混合物在室温下搅拌 3h。然后,在减压下将溶剂蒸馏出,并通过柱层析纯化法用作为洗脱液的水/乙腈梯度纯化残余物。

[0618] ($\log P$ (中性): 4.07; MH^+ : 325; ^1H NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1.32 (t, 3H), 3.10 (q, 2H), 7.42 (t, 1H), 7.60–7.69 (m, 2H), 8.21 (d, 1H), 8.54 (s, 1H), 9.33 (s, 1H)。

[0619] 制备 2-(乙基硫烷基)-N-[5-羟基-2-(三氟甲基)吡啶-4-基]苯甲酰胺 (VIII-02)

[0620]



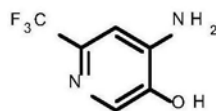
[0621] 将 206mg (1.12mmol) 的 2-(乙基硫烷基)苯甲酸和 201mg (1.12mmol) 的 4-氨基-6-(三氟甲基)吡啶-3-醇溶于 5ml 的吡啶中,加入 325mg (1.69mmol) 的 1-(3-二甲氨基丙基)-3-乙基碳二亚胺盐酸盐 (EDCI),并且将混合物在 50℃ 下搅拌 2h 并在 80℃ 下搅拌 3h。在减压下将溶剂蒸馏出,并将残余物溶于水中并用乙酸乙酯萃取。用氯化钠溶液将

有机相洗涤,移出,经硫酸钠干燥,并浓缩。通过柱层析纯化法借助制备型 HPLC 用作为洗脱液的水 / 乙腈梯度纯化残余物。

[0622] (logP(中性):1.59; MH^+ :343; 1H NMR(400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm:1.21(t, 3H), 2.98(q, 2H), 7.29-7.34(m, 1H), 7.48-7.53(m, 2H), 7.61(d, 1H), 8.29(s, 1H), 8.55(s, 1H), 9.99(s, 1H), 11.31(br. S, 1H)。

[0623] 制备 4-氨基-6-(三氟甲基)吡啶-3-醇 (II-02)

[0624]

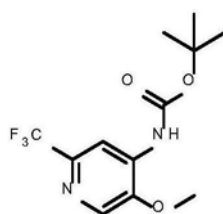


[0625] 将 12.3g(42.1mmol) 的 [5-甲氧基-2-(三氟甲基)吡啶-4-基] 氨基甲酸叔丁酯溶于 300ml 的二氯甲烷中并冷却至 $-78^\circ C$, 并在该温度下逐滴加入 42.2g(168mmol) 的三溴化硼于 150ml 的二氯甲烷的溶液。将该混合物升至室温过夜, 然后加入 400ml 的碳酸氢钠溶液, 并将混合物每次用 100ml 的二氯甲烷萃取三次。将溶剂蒸馏出, 并通过层析法在硅胶上纯化残余物。

[0626] (1H NMR(90MHz, D_6 -DMSO) δ ppm:7.00(s, 1H), 7.9(s, 1H)。

[0627] 制备 [5-甲氧基-2-(三氟甲基)吡啶-4-基] 氨基甲酸叔丁酯

[0628]

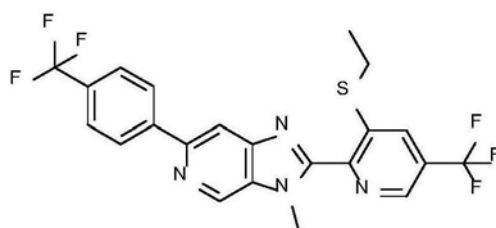


[0629] 在室温下, 向 9.80g(44.3mmol) 的 5-甲氧基-2-(三氟甲基)异烟酸于 980ml 的叔丁醇的溶液中加入 65g 的 4A 分子筛、14.6g(53.1mmol) 的二苯基磷酰基叠氮化物 (DPPA) 和 5.37g(53.1mmol) 的三乙胺。在 $81^\circ C$ 下将反应混合物搅拌 23h, 然后过滤出 4A 分子筛。在减压下将叔丁醇蒸馏出后, 将残余物与 500ml 的乙酸乙酯混合, 用 250ml 的 2N 盐酸、250ml 的碳酸氢钠饱和水溶液、250ml 的水和 250ml 的氯化钠溶液洗涤, 并经硫酸钠干燥。在减压下将溶剂移出, 并将残余物每次用 15ml 的乙酸乙酯洗涤三次以及在减压下干燥。通过层析法在硅胶 (己烷/EtOAc4:1 = >2:1) 上纯化乙酸乙酯相。

[0630] (1H NMR(90MHz, $CDCl_3$) δ ppm:1.5(s, 9H), 4.0(s, 3H), 8.2(s, 1H), 8.5(s, 1H)。

[0631] 制备 2-[3-乙基硫烷基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-6-[4-(三氟甲基)-苯基]咪唑并 [4,5-c] 吡啶 (I-64)

[0632]



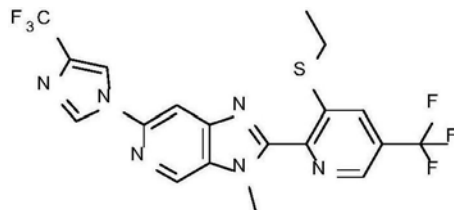
[0633] 在超声浴中, 对 62mg(0.58mmol) 的碳酸钠于 2ml 的 1,2-二甲氧基乙烷与水的

4:1 混合物的溶液进行脱气, 并加入 73mg (0.19mmol) 的 6-氯-2-[3-乙基硫烷基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基咪唑并[4,5-c]吡啶和 67mg (0.35mmol) 的[4-(三氟甲基)苯基]硼酸。将容器中充满氩气, 然后加入 23mg (20 μmol) 的四(三苯基膦)钯。在 CEM Discover 微波中将混合物加热至 140℃ 维持 2h 10min, 然后再与另外 68mg (59 μmol) 的四(三苯基膦)钯混合, 并加热至 140℃ 再维持 4h。将反应混合物经由已用乙酸乙酯冲洗的硅藻土层 (Celite bed) 过滤。在减压下除去溶剂后, 将残余物通过 MPLC 在硅胶 (梯度: 乙酸乙酯 / 环己烷) 上进行层析分离。然后通过制备型 HPLC (梯度: H₂O / 乙腈) 再次进行层析分离。以此方式, 得到了 14mg (纯度 99%, 收率 15%) 的 2-[3-乙基硫烷基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-6-[4-(三氟甲基)苯基]咪唑并[4,5-c]吡啶。

[0634] (logP (中性): 3.95; MH⁺: 483; ¹H NMR (400MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 9.275 (2.6); 9.271 (2.5); 8.943 (4.3); 8.584 (2.6); 8.580 (2.6); 8.318 (0.5); 7.701 (3.0); 7.680 (3.9); 7.548 (3.8); 7.527 (3.0); 7.410 (4.6); 3.890 (16.0); 3.329 (75.4); 3.140 (1.3); 3.122 (4.2); 3.104 (4.3); 3.086 (1.4); 2.676 (0.9); 2.671 (1.2); 2.667 (0.9); 2.507 (140.3); 2.502 (179.9); 2.498 (134.5); 2.334 (0.9); 2.329 (1.2); 2.325 (0.9); 1.281 (4.6); 1.263 (9.7); 1.245 (4.5); 0.146 (0.4); 0.008 (3.6); 0.000 (84.0); -0.150 (0.4)。

[0635] 制备 2-[3-乙基硫烷基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-6-[4-(三氟甲基)-咪唑-1-基]咪唑并[4,5-c]吡啶 (I-74)

[0636]



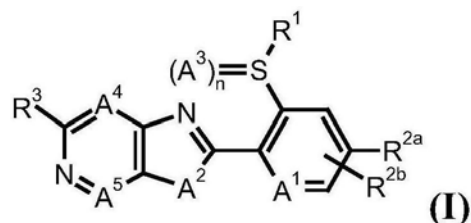
[0637] 在氩气下, 将 99mg (0.27mmol) 的 6-氯-2-[3-乙基硫烷基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基咪唑并[4,5-c]吡啶、23 μl (0.15mmol) 的反式-N,N'-二甲基环己烷-1,2-二胺、6.8mg (36 μmol) 的碘化亚铜 (I)、30mg (0.22mmol) 的 4-(三氟甲基)-1H-咪唑和 64mg (0.46mmol) 的碳酸钾加入到 1ml 的脱气甲苯中。将容器密封, 并在 CEM Discover 微波反应器中将反应混合物加热至 110℃ 维持 4h。冷却至室温后, 加入乙酸乙酯并将混合物经由硅藻土层过滤, 该硅藻土层随后用乙酸乙酯冲洗。在减压下除去溶剂, 并将残余物通过 MPLC 在硅胶 (梯度: 乙酸乙酯 / 环己烷) 上进行层析分离。以此方式, 得到 22mg (纯度 100%, 收率 18%) 的 2-[3-乙基硫烷基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-6-[4-(三氟甲基)-咪唑-1-基]咪唑并[4,5-c]吡啶。

[0638] (logP (中性): 3.36; MH⁺: 473; ¹H NMR (600MHz, CD₃CN) δ ppm: 8.905 (3.0); 8.903 (3.0); 8.852 (1.6); 8.850 (1.6); 8.500 (1.9); 8.313 (1.5); 8.311 (2.1); 8.309 (1.4); 8.183 (1.7); 8.181 (1.7); 7.962 (3.4); 7.961 (3.4); 4.001 (16.0); 3.940 (0.4); 3.124 (1.1); 3.111 (3.4); 3.099 (3.5); 3.087 (1.2); 2.639 (0.7); 2.184 (55.7); 2.109 (1.2); 2.005 (2.2); 1.998 (195.7); 1.989 (2.7); 1.985 (1.8); 1.981 (10.0); 1.977 (18.2); 1.973 (26.5); 1.969 (18.0); 1.965 (9.0); 1.882 (1.2);

1.419(0.4) ;1.404(0.7) ;1.373(0.6) ;1.330(4.1) ;1.318(9.0) ;1.309(1.6) ;
1.305(5.2) ;1.301(3.4) ;0.914(0.6)。

[0639] 类似于实施例并根据上述制备方法,可得到下列式 (I) 的化合物:

[0640]



[0641] 其中 A³为氧且其他取代基各自如下表中定义:

[0642]

实施例	R ¹	N	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-1	CH ₃	0	N	CH	CF ₃	O	CH	Cl	H
I-2	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-3	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-4	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	F	H
I-5	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	CF ₃	H
I-6	CH ₃	0	N	CH	CF ₃	N-甲基	CH	Cl	H
I-7	-(CH ₂) ₂ -SO ₂ -C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-8	i-C ₃ H ₇	1	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-9	C ₂ H ₅	0	N	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-10	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	Cl	H
I-11	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	Cl	H
I-12	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	F	H
I-13	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	H	5-Cl*
I-14	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	3	H
I-15	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	H
I-16	i-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-17	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	H	H
I-18	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	H	H
I-19	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	H	5-Cl*
I-20	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	F	H
I-21	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-22	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	H	H
I-23	-(CH ₂) ₂ -S-C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-24	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	H

[0643]

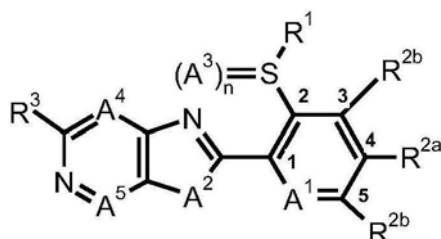
实施例	R ¹	N	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-25	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	Cl	H
I-26	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-27	氧杂环丁烷-3-基	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	H	H
I-28	C ₂ H ₅	0	N	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-29	CF ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	H
I-30	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	CF ₃	H
I-31	n-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-32	n-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-33	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	H
I-34	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	Cl	H
I-35	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-36	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-37	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-38	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	H	5-Cl*
I-39	n-C ₃ H ₇	1	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-40	氧杂环丁烷-3-基	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-41	i-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-42	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	Cl	H
I-43	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	Cl	H
I-44	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	Cl	H
I-45	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	5-OMe*
I-46	C ₂ H ₅	0	CH	CH	C ₂ F ₅	N-甲基	N	H	H
I-47	C ₂ H ₅	0	CH	CH	C ₂ F ₅	N-甲基	N	CF ₃	H
I-48	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	3-CF ₃ *
I-49	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	5-NHCOMe*
I-50	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	5-NHCOMe*
I-51	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	3-CF ₃ *
I-52	C ₂ H ₅	2	CH	CH	Cl	N-甲基	N	CF ₃	H
I-53	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	5-OMe*
I-54	CH ₂ -CH ₂ F	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-55	C ₂ H ₅	0	CH	CH	Cl	N-甲基	N	CF ₃	H
I-56	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CONH ₂	H
I-57	CH ₂ -CH ₂ F	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-58	CH ₂ -CH ₂ OH	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-59	CH ₂ -CH ₂ OH	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CF ₃	H
I-60	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CONH ₂	H
I-61	C ₂ H ₅	1	CH	CH	C ₂ F ₅	N-甲基	N	H	H
I-62	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	CH	H	3-Cl*
I-63	C ₂ H ₅	1	CH	CH	C ₂ F ₅	N-甲基	N	CF ₃	H

[0644]

实施例	R ¹	N	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-64	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-CF ₃ (C ₆ H ₄)	N-甲基	N	CF ₃	H
I-65	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-(CF ₃)吡唑 -1-基	N-甲基	N	CF ₃	H
I-66	n-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	5-OMe*
I-67	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	5-OMe*
I-68	C ₂ H ₅	2	CH	CH	C ₂ F ₅	N-甲基	N	H	H
I-69	C ₂ H ₅	0	CH	CH	3-(CF ₃)吡唑 -1-基	N-甲基	N	CF ₃	H
I-70	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	3-CF ₃ *
I-71	n-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	5-OMe*
I-72	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	CN	H
I-73	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-甲基	N	H	5-OMe*
I-74	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-(CF ₃)咪唑 -1-基	N-甲基	N	CF ₃	H
I-75	C ₂ H ₅	2	CH	CH	4-(CF ₃)咪唑 -1-基	N-甲基	N	CF ₃	H
I-76	C ₂ H ₅	2	CH	CH	4-(CF ₃)吡唑 -1-基	N-甲基	N	CF ₃	H
I-77	C ₂ H ₅	2	CH	CH	3-(CF ₃)吡唑 -1-基	N-甲基	N	CF ₃	H

[0645] * 在这些实施例中, R^{2b}连接在 3 或 5 位上:

[0646]



[0647] LogP 值根据 EEC 指示 79/831 附录 V. A8 通过 HPLC (高效液相色谱法) 在反相柱 (C 18) 上测定。温度 :55℃。

[0648] 在酸性范围内 LC-MS 测定在 pH 2.7 下利用 0.1% 含水甲酸和乙腈 (含有 0.1% 的甲酸) 作为洗脱液、10% 乙腈至 95% 乙腈的线性梯度下进行。在表中称为 logP (HCOOH)。

[0649] 在中性范围下 LC-MS 测定在 pH 7.8 下使用 0.001 摩尔的碳酸氢铵水溶液和乙腈作为洗脱液、10% 乙腈至 95% 乙腈的线性梯度下进行。在表中称为 logP (中性)。

[0650] 使用具有已知 logP 值 (基于保留时间在两个连续的烷基酮之间通过线性内插法测定 logP 值) 的无支链的烷基-2-酮 (具有 3 至 16 个碳原子) 进行校准。

[0651] 所选实施例的 NMR 数据既可以常规形式 (δ 值, 多重分裂, 氢原子的数目) 列出, 还可以 NMR 峰值列表列出。

[0652] 在每种情况下均记载记录 NMR 谱的溶剂。

[0653] NMR 峰值列表的方法

[0654] 所选实施例的 ^1H NMR 数据以 ^1H NMR 峰值列表的形式记录。对于每个信号峰,首先列出以 ppm 为单位的 δ 值,然后是圆括号内的信号强度。对于不同信号峰值的 δ 值 - 信号强度数对之间彼此以分号分隔列出。

[0655] 因此,一个实例的峰值列表采用以下形式:

[0656] δ_1 (强度₁); δ_2 (强度₂); ; δ_i (强度_i); ; δ_n (强度_n)

[0657] 在以 cm 为单位的 NMR 谱的展示实例中,尖锐信号的强度与信号的高度相关,其表明信号强度的真实比例。在宽信号的情况中,多个峰或中间信号及其相对强度可以与光谱中最强信号相比而示出。

[0658] 对于 ^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,特别是在 DMSO 中测量的光谱的情况下。因此,四甲基硅烷峰可以但不一定在 NMR 峰列表中出现。

[0659] ^1H NMR 峰值的列表类似于常规 ^1H NMR 打印输出,因此,其通常含有在常规 NMR 说明中列出的所有峰。

[0660] 另外,如同常规 ^1H NMR 的打印输出,其可显示出溶剂信号、目标化合物的立体异构体(其同样构成了本发明主题的一部分)的信号、和/或杂质峰。

[0661] 在溶剂和/或水的增量范围中的化合物信号的报告中, ^1H NMR 峰值的列表示出一般的溶剂峰,例如在 DMSO-D₆ 中的 DMSO 峰和水的峰,这通常具有高的平均强度。

[0662] 目标化合物的立体异构体的峰和/或杂质峰通常具有比目标化合物(例如具有 >90% 的纯度)的峰更低的平均强度。

[0663] 这些立体异构体和/或杂质可为特定制备方法特有的。因此,在这种情况下,它们的峰可对照“副产品指纹图谱”帮助识别我们制备方法的再现性。

[0664] 如果需要,计算目标化合物峰的专家通过已知方法(MestreC, ACD 模拟,也具有凭经验评估的预期值)可以任选地使用附加的强度滤波器分离出目标化合物的峰。这种分离类似于常规 ^1H NMR 说明中相关峰值的拾取。

[0665] ^1H NMR 峰值列表的其他细节可以见于 Research Disclosure Database Number 564025。

[0666]

实施例	LOGP_ 中性	LOGP_ HCOOH	
I-1	3.77	3.86	实施例 1: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.544 (6.4); 8.335 (3.9); 8.314 (4.1); 7.568 (2.9); 7.563 (3.5); 7.534 (2.5); 7.529 (1.9); 7.513 (2.3); 7.508 (1.9); 3.323 (17.6); 2.671 (0.3); 2.631 (16.0); 2.524 (1.1); 2.511 (19.3); 2.507 (38.0); 2.502 (49.6); 2.498 (35.5); 2.493 (16.9); 2.075 (0.5); 0.008 (0.9); 0.000 (21.7); -0.008 (0.7)
I-2	3.48	3.52	实施例 2: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.283 (3.7); 8.960 (2.3); 8.958 (2.3); 8.334 (2.7); 8.328 (4.1); 4.030 (16.0); 3.323 (69.7); 3.181 (1.1); 3.162 (3.6); 3.144 (3.6); 3.126 (1.1); 2.891 (1.2); 2.731 (1.0); 2.676 (0.4); 2.671 (0.6); 2.667 (0.4); 2.506 (64.4); 2.502 (83.6); 2.498 (61.3); 2.333 (0.4); 2.329 (0.5); 2.324 (0.4); 1.234 (4.1); 1.215 (8.1); 1.197 (3.8); 0.008 (0.6); 0.000 (17.0); -0.008 (0.7)
I-3	3.16	3.22	实施例 3: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.290 (4.0); 8.947 (2.7); 8.316 (4.5); 8.267 (2.9); 7.953 (0.4); 4.059 (16.0); 4.019 (0.7); 3.327 (63.2); 3.036 (0.3); 2.965 (0.4); 2.892 (2.5); 2.882 (0.5); 2.870 (0.5); 2.732 (2.2); 2.673 (0.5); 2.580 (15.1); 2.507 (59.9); 2.503 (71.6); 2.499 (52.5); 2.330 (0.5); 2.078 (0.4); 1.234 (0.4); 0.000 (0.4)
I-4	2.65	2.70	实施例 4: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.833 (0.3); 9.210 (3.9); 8.226 (4.1); 8.082 (0.6); 7.993 (0.5); 7.608 (1.3); 7.593 (1.5); 7.587 (1.6); 7.572 (1.4); 7.411 (1.3); 7.405 (1.4); 7.386 (1.4); 7.380 (1.4); 7.244 (1.0); 7.238 (0.9); 7.222 (1.6); 7.216 (1.5); 7.201 (0.8); 7.195 (0.7); 3.785 (16.0); 3.325 (80.3); 2.875 (1.0); 2.863 (1.0); 2.671 (0.7); 2.667 (0.6); 2.506 (76.1); 2.502 (99.5); 2.498 (78.2); 2.464 (2.7); 2.329 (0.6); 2.075 (0.3); 0.000 (2.6)
I-5	3.26	3.30	实施例 5: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.249 (3.5); 8.267 (3.7); 7.787 (1.2); 7.778 (2.7); 7.768 (2.9); 7.749 (2.1); 7.729 (0.7); 3.807 (16.0); 3.324 (21.7); 2.671 (0.4); 2.557 (15.5); 2.524 (1.1); 2.511 (22.7); 2.507 (44.4); 2.502 (57.4); 2.498 (41.7); 2.493 (20.4); 2.329 (0.4); 0.008 (2.1); 0.000 (52.3); -0.009 (2.1)
I-6	2.74	2.75	实施例 6: ^1H -NMR (601.6 MHz, CD_3CN): δ = 9.182 (3.5); 7.526 (1.9); 7.523 (2.0); 7.459 (1.7); 7.445 (2.7); 7.403 (1.7); 7.400 (1.6); 7.390 (1.1); 7.386 (1.0); 3.927 (0.3); 3.770 (16.0);

[0667]

			2.978 (0.3); 2.494 (14.5); 2.222 (0.5); 2.152 (1.6); 1.966 (0.6); 1.958 (1.5); 1.954 (1.8); 1.950 (9.9); 1.946 (17.5); 1.942 (25.9); 1.938 (17.6); 1.934 (8.7); 1.387 (5.1); 1.269 (0.3); 1.212 (0.4); 0.005 (0.3); 0.000 (11.9); -0.006 (0.4)
I-7	2.67	2.72	实施例 7: ^1H-NMR (400.0 MHz, d_6-DMSO): δ = 9.411 (2.3); 9.408 (2.3); 9.379 (3.9); 9.333 (0.4); 8.751 (2.4); 8.746 (2.5); 8.460 (4.1); 8.316 (0.5); 7.903 (0.3); 4.391 (16.0); 4.199 (1.2); 4.147 (0.5); 4.138 (0.4); 4.121 (0.8); 4.114 (0.6); 4.107 (0.7); 4.100 (0.7); 4.088 (0.7); 4.068 (0.4); 3.976 (0.7); 3.854 (0.6); 3.843 (0.6); 3.833 (0.7); 3.829 (0.7); 3.819 (0.8); 3.803 (0.5); 3.795 (0.6); 3.556 (0.6); 3.543 (0.8); 3.531 (0.5); 3.523 (0.6); 3.518 (0.8); 3.510 (0.9); 3.494 (1.8); 3.477 (0.8); 3.468 (0.8); 3.464 (0.6); 3.455 (0.5); 3.443 (0.6); 3.429 (0.4); 3.325 (63.6); 3.260 (0.8); 3.257 (0.8); 3.241 (2.2); 3.238 (2.3); 3.223 (2.3); 3.219 (2.3); 3.201 (0.9); 2.676 (0.5); 2.671 (0.7); 2.667 (0.6); 2.524 (1.8); 2.511 (41.0); 2.506 (84.3); 2.502 (113.7); 2.498 (86.8); 2.493 (45.8); 2.333 (0.5); 2.329 (0.7); 2.324 (0.6); 1.252 (4.4); 1.233 (9.5); 1.214 (4.3); 0.146 (0.4); 0.008 (2.7); 0.000 (79.8); -0.008 (4.6); -0.150 (0.4)
I-8	3.46	3.54	实施例 8: ^1H-NMR (400.0 MHz, d_6-DMSO): δ = 9.390 (2.1); 9.387 (2.1); 9.377 (3.6); 8.577 (2.1); 8.572 (2.2); 8.379 (3.7); 8.316 (0.6); 4.384 (16.0); 4.362 (0.4); 3.802 (0.3); 3.785 (0.9); 3.767 (1.3); 3.750 (0.9); 3.733 (0.4); 3.322 (86.4); 2.675 (1.0); 2.671 (1.4); 2.666 (1.0); 2.524 (3.7); 2.511 (79.1); 2.506 (160.9); 2.502 (213.1); 2.497 (155.9); 2.493 (76.9); 2.333 (1.0); 2.329 (1.4); 2.324 (1.0); 1.569 (6.3); 1.551 (6.2); 0.906 (6.4); 0.889 (6.3); 0.146 (1.3); 0.008 (10.0); 0.000 (280.2); -0.008 (11.2); -0.150 (1.3)
I-9	3.64	3.66	实施例 9: ^1H-NMR (400.0 MHz, d_6-DMSO): δ = 9.544 (9.2); 8.314 (2.7); 8.311 (2.8); 8.294 (2.9); 8.291 (2.8); 7.739 (1.1); 7.735 (1.2); 7.719 (2.5); 7.715 (2.1); 7.701 (2.2); 7.697 (2.1); 7.646 (3.6); 7.627 (2.2); 7.464 (1.9); 7.462 (1.8); 7.444 (3.0); 7.426 (1.6); 7.424 (1.5); 3.322 (31.6); 3.155 (1.9); 3.136 (6.3); 3.118 (6.4); 3.100 (2.0); 2.676 (0.6); 2.671 (0.8); 2.666 (0.6); 2.541 (0.6); 2.524 (2.7); 2.511 (49.3); 2.507 (97.6); 2.502 (126.8); 2.497 (89.7); 2.493 (42.1); 2.333 (0.6); 2.329 (0.8); 2.324 (0.6); 2.075 (0.3); 1.360 (7.3); 1.341 (16.0); 1.323 (7.0); 0.146 (0.3); 0.008 (3.4); 0.000 (84.9); -0.009 (2.9); -0.150 (0.3)
I-10	2.08	2.15	实施例 10: ^1H-NMR (400.0 MHz, d_6-DMSO): δ = 9.271 (3.7); 8.267 (3.9); 8.137 (2.9); 8.132 (3.0); 7.975 (2.1); 7.954 (3.6); 7.900 (2.2); 7.895 (2.1); 7.880 (1.3); 7.874 (1.3); 6.870 (0.3); 3.977 (15.9); 3.748 (0.9); 3.444 (0.8); 3.327 (95.2); 2.967 (16.0); 2.676 (0.3); 2.671 (0.5); 2.667 (0.3); 2.525 (1.4); 2.507 (54.5); 2.502 (70.2); 2.498 (50.6); 2.494 (24.6); 2.333 (0.3); 2.329 (0.4); 2.184 (0.5); 1.355 (3.8); 1.298 (0.9); 1.259 (1.2); 1.234 (0.6); 0.008 (2.1); 0.000 (54.1); -0.009 (2.3)
I-11	2.34	2.39	实施例 11: ^1H-NMR (400.0 MHz, d_6-DMSO): δ = 9.279 (0.6); 9.262 (3.9); 8.380 (0.5); 8.317 (0.5); 8.260 (4.2); 8.164 (2.8); 8.159 (3.4); 8.152 (0.5); 8.115 (1.7); 8.110 (1.5); 8.095 (2.1);

[0668]

			8.089 (1.9); 7.937 (3.4); 7.917 (3.0); 7.902 (0.8); 7.897 (0.9); 7.885 (0.5); 7.565 (0.4); 7.545 (0.6); 5.757 (1.6); 3.770 (0.5); 3.747 (16.0); 3.621 (0.4); 3.592 (1.6); 3.445 (15.1); 3.436 (2.1); 3.327 (141.8); 2.675 (0.9); 2.671 (1.2); 2.667 (0.9); 2.524 (4.2); 2.506 (141.2); 2.502 (182.5); 2.498 (131.5); 2.333 (0.8); 2.329 (1.1); 2.324 (0.8); 1.298 (0.8); 1.259 (1.1); 1.235 (0.5); 1.166 (0.3); 0.008 (2.3); 0.000 (56.4); -0.008 (2.3)
I-12	1.83	1.88	实施例 12: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.272 (4.2); 8.266 (4.5); 8.036 (1.3); 8.023 (1.4); 8.015 (1.6); 8.002 (1.5); 7.966 (1.4); 7.959 (1.6); 7.944 (1.5); 7.937 (1.5); 7.706 (0.8); 7.699 (0.8); 7.685 (1.5); 7.678 (1.5); 7.664 (0.8); 7.657 (0.7); 3.973 (16.0); 3.336 (80.5); 2.958 (16.0); 2.678 (0.4); 2.549 (0.3); 2.509 (67.3); 2.337 (0.4)
I-13	2.34	2.44	实施例 13: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.285 (3.9); 8.280 (4.2); 8.088 (2.3); 8.066 (4.9); 8.060 (3.8); 8.009 (2.3); 8.004 (2.0); 7.988 (1.4); 7.983 (1.3); 3.973 (16.0); 3.327 (56.5); 3.313 (1.6); 3.294 (1.2); 3.279 (1.2); 3.261 (1.1); 3.242 (0.3); 2.905 (1.1); 2.886 (1.2); 2.871 (1.0); 2.853 (1.0); 2.671 (0.4); 2.507 (41.3); 2.502 (56.0); 2.498 (43.9); 2.329 (0.4); 1.150 (3.8); 1.132 (8.2); 1.113 (3.7); 0.000 (2.5)
I-14	2.63	2.67	实施例 14: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.289 (3.7); 8.430 (1.3); 8.412 (5.2); 8.288 (3.9); 8.287 (3.9); 8.180 (1.6); 8.159 (1.4); 3.772 (16.0); 3.493 (14.4); 3.324 (34.4); 2.524 (0.9); 2.511 (17.9); 2.506 (36.4); 2.502 (48.8); 2.497 (36.6); 2.493 (18.8); 0.008 (1.9); 0.000 (52.6); -0.008 (2.6)
I-15	1.92	1.95	实施例 15: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.295 (3.5); 9.139 (1.7); 9.135 (1.9); 9.127 (1.9); 9.123 (1.8); 8.579 (1.7); 8.575 (1.8); 8.559 (1.9); 8.555 (1.8); 8.300 (3.6); 8.298 (3.7); 8.021 (1.9); 8.009 (1.8); 8.001 (1.7); 7.989 (1.7); 3.867 (16.0); 3.794 (1.0); 3.775 (3.5); 3.757 (3.5); 3.738 (1.0); 3.327 (10.2); 2.526 (0.5); 2.521 (0.7); 2.512 (10.8); 2.508 (22.2); 2.503 (29.5); 2.499 (21.4); 2.494 (10.4); 1.209 (3.6); 1.191 (7.9); 1.172 (3.5); 0.008 (1.8); 0.000 (50.2); -0.009 (1.9)
I-16	3.21	3.26	实施例 16: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.588 (2.0); 9.585 (2.1); 9.314 (3.5); 8.780 (2.2); 8.776 (2.2); 8.331 (3.7); 8.316 (0.4); 4.409 (0.3); 4.392 (1.0); 4.375 (1.4); 4.357 (1.0); 4.340 (0.3); 3.914 (16.0); 3.322 (36.9); 2.676 (0.6); 2.671 (0.8); 2.667 (0.6); 2.524 (2.0); 2.520 (3.2); 2.511 (42.6); 2.507 (88.2); 2.502 (118.2); 2.497 (86.9); 2.493 (42.9); 2.333 (0.5); 2.329 (0.7); 2.324 (0.6); 1.260 (13.3); 1.243 (13.2); 0.146 (0.8); 0.008 (6.7); 0.000 (191.2); -0.009 (7.6); -0.150 (0.8)
I-17	2.87	2.94	实施例 17: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.204 (3.8); 8.228 (4.1); 7.627 (3.7); 7.618 (4.2); 7.536 (1.5); 7.517 (2.1); 7.433 (0.9); 7.422 (1.2); 7.413 (1.2); 7.403 (1.1); 7.392 (0.6); 3.768 (16.0); 3.327 (67.1); 2.986 (1.3); 2.968 (4.1); 2.950 (4.1); 2.931 (1.4); 2.671 (0.5); 2.667 (0.3); 2.507 (57.2); 2.503 (74.4); 2.498 (54.2); 2.334 (0.3); 2.329 (0.5); 2.325 (0.4); 1.180 (4.3); 1.161 (8.7); 1.143

[00669]

			(4.1); 0.146 (0.5); 0.008 (3.9); 0.000 (88.8); -0.007 (3.9); -0.150 (0.5)
I-18	2.11	2.13	实施例 18: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.255 (3.5); 8.253 (3.7); 8.251 (3.6); 8.156 (1.3); 8.153 (1.3); 8.138 (1.8); 8.134 (1.6); 8.020 (0.4); 8.017 (0.5); 8.002 (1.4); 7.998 (1.4); 7.984 (1.6); 7.979 (1.5); 7.976 (1.4); 7.971 (1.6); 7.957 (1.5); 7.953 (1.5); 7.938 (0.6); 7.934 (0.5); 7.878 (1.7); 7.875 (1.8); 7.860 (1.2); 7.857 (1.2); 3.728 (16.0); 3.526 (0.5); 3.509 (1.3); 3.490 (1.3); 3.473 (0.5); 3.330 (61.8); 2.671 (0.4); 2.525 (1.2); 2.511 (25.5); 2.507 (50.6); 2.502 (65.3); 2.498 (46.3); 2.493 (21.9); 2.329 (0.4); 1.119 (3.5); 1.101 (7.8); 1.082 (3.4); 0.008 (0.6); 0.000 (15.4); -0.009 (0.6)
I-19	3.38	3.43	实施例 19: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.226 (3.9); 8.243 (4.1); 7.705 (0.9); 7.699 (1.3); 7.684 (1.6); 7.678 (2.9); 7.667 (3.6); 7.662 (2.3); 7.640 (3.4); 7.619 (1.8); 3.788 (16.0); 3.323 (25.4); 2.999 (1.2); 2.981 (4.0); 2.963 (4.1); 2.944 (1.3); 2.671 (0.4); 2.626 (0.3); 2.507 (47.1); 2.502 (61.4); 2.498 (45.8); 2.329 (0.4); 2.300 (0.5); 1.177 (4.3); 1.159 (8.9); 1.140 (4.1); 0.008 (1.9); 0.000 (45.5)
I-20	2.05	2.08	实施例 20: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.258 (4.1); 8.253 (4.3); 7.997 (1.5); 7.990 (2.5); 7.976 (2.4); 7.969 (3.3); 7.956 (1.7); 7.918 (1.1); 7.911 (0.9); 7.897 (1.6); 7.890 (1.4); 7.876 (0.7); 7.869 (0.6); 3.739 (16.0); 3.430 (15.0); 3.326 (81.6); 2.671 (0.7); 2.666 (0.6); 2.506 (84.7); 2.502 (108.3); 2.498 (84.4); 2.328 (0.7); 2.325 (0.5); 0.146 (0.6); 0.000 (128.1); -0.150 (0.6)
I-21	2.93	2.98	实施例 21: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.586 (2.4); 9.583 (2.5); 9.317 (4.1); 8.798 (2.5); 8.794 (2.6); 8.341 (4.3); 3.925 (16.0); 3.912 (1.3); 3.893 (3.6); 3.874 (3.7); 3.856 (1.1); 3.324 (30.3); 2.671 (0.5); 2.506 (56.1); 2.502 (72.8); 2.498 (55.3); 2.329 (0.5); 1.258 (3.8); 1.239 (8.2); 1.221 (3.7); 0.146 (0.4); 0.007 (3.2); 0.000 (79.6); -0.150 (0.4)
I-22	1.87	1.90	实施例 22: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.261 (3.9); 8.261 (4.1); 8.107 (1.6); 8.087 (2.0); 7.942 (0.8); 7.940 (1.0); 7.921 (1.7); 7.904 (2.1); 7.901 (2.4); 7.885 (2.2); 7.820 (1.2); 7.818 (1.3); 7.801 (1.6); 7.799 (1.6); 7.783 (0.6); 7.780 (0.7); 5.757 (1.1); 3.946 (16.0); 3.728 (0.5); 3.328 (59.2); 3.305 (1.0); 3.286 (1.1); 3.272 (1.1); 3.253 (1.1); 2.885 (1.1); 2.867 (1.2); 2.852 (1.0); 2.833 (1.0); 2.672 (0.3); 2.507 (37.2); 2.502 (48.9); 2.498 (35.7); 1.149 (3.9); 1.130 (8.2); 1.112 (3.7); 1.102 (0.4); 0.007 (1.5); 0.000 (35.2); -0.008 (1.5)
I-23	3.96	4.02	实施例 23: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.288 (4.1); 8.977 (2.7); 8.456 (2.7); 8.327 (4.3); 8.317 (0.4); 4.033 (16.0); 3.395 (2.0); 3.377 (2.7); 3.357 (2.4); 3.327 (77.5); 2.720 (2.3); 2.701 (2.8); 2.682 (2.2); 2.672 (0.7); 2.579 (1.5); 2.560 (4.6); 2.542 (4.9); 2.523 (3.2); 2.507 (65.1); 2.502 (87.7); 2.498 (70.2); 2.329 (0.6); 2.075 (0.9); 1.233 (0.6); 1.152 (4.7); 1.133 (9.3); 1.115 (4.4); 0.000 (3.7)
I-24	2.32	2.39	实施例 24: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.241 (3.7); 8.588 (1.6); 8.585 (1.8); 8.577 (1.7); 8.574 (1.8); 8.279

[0670]

			(3.8); 8.090 (1.5); 8.087 (1.6); 8.069 (1.7); 8.066 (1.8); 7.638 (1.6); 7.627 (1.6); 7.618 (1.5); 7.606 (1.5); 3.975 (16.0); 3.324 (34.0); 3.041 (1.1); 3.022 (3.7); 3.004 (3.8); 2.986 (1.2); 2.672 (0.3); 2.525 (0.8); 2.507 (40.5); 2.503 (55.3); 2.498 (43.4); 2.329 (0.4); 1.218 (4.0); 1.199 (8.3); 1.181 (3.9); 0.008 (1.5); 0.000 (45.1)
I-25	2.97	3.08	实施例 25: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.217 (3.6); 8.235 (3.9); 7.564 (2.9); 7.560 (3.0); 7.555 (3.0); 7.544 (3.5); 7.460 (2.0); 7.455 (1.8); 7.440 (1.4); 7.435 (1.3); 3.791 (16.0); 3.323 (28.6); 2.671 (0.3); 2.506 (48.4); 2.502 (56.6); 2.498 (37.8); 2.329 (0.4); 1.398 (0.8); 0.008 (2.5); 0.000 (64.5); -0.008 (2.5)
I-26	2.76	2.81	实施例 26: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.389 (2.0); 9.386 (2.0); 9.366 (3.5); 8.849 (2.2); 8.845 (2.1); 8.370 (3.7); 6.870 (0.5); 5.756 (0.4); 4.452 (0.5); 4.347 (15.7); 4.018 (0.6); 3.995 (0.4); 3.326 (80.4); 3.151 (16.0); 2.676 (0.4); 2.671 (0.5); 2.667 (0.3); 2.524 (1.2); 2.511 (28.7); 2.507 (56.3); 2.502 (72.6); 2.498 (52.3); 2.494 (25.3); 2.334 (0.4); 2.329 (0.5); 2.325 (0.3); 2.183 (0.8); 1.355 (5.8); 1.233 (0.6); 0.008 (1.2); 0.000 (33.6); -0.009 (1.3)
I-27	1.84	1.87	实施例 27: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.253 (3.5); 8.275 (3.8); 8.273 (3.7); 8.257 (1.5); 8.254 (1.4); 8.237 (1.8); 8.234 (1.7); 8.038 (0.5); 8.035 (0.6); 8.020 (1.5); 8.016 (1.6); 8.001 (1.5); 7.998 (1.3); 7.984 (1.2); 7.980 (1.4); 7.965 (1.6); 7.961 (1.7); 7.946 (0.7); 7.942 (0.6); 7.903 (0.9); 7.895 (2.1); 7.892 (2.0); 7.877 (1.4); 7.873 (1.3); 7.567 (0.4); 7.547 (0.6); 5.756 (8.2); 5.231 (0.7); 5.226 (0.6); 5.216 (0.5); 5.211 (1.3); 5.205 (0.5); 5.196 (0.7); 5.190 (0.8); 5.175 (0.4); 4.802 (2.1); 4.783 (4.1); 4.763 (2.6); 4.673 (2.9); 4.657 (3.1); 4.639 (2.0); 3.746 (16.0); 3.732 (0.5); 3.602 (0.5); 3.594 (0.5); 3.325 (51.0); 2.676 (0.3); 2.671 (0.4); 2.524 (1.2); 2.511 (26.7); 2.507 (53.3); 2.502 (69.4); 2.498 (49.5); 2.493 (23.4); 2.333 (0.3); 2.329 (0.5); 1.760 (0.5); 1.236 (0.7); 1.190 (0.3); 0.000 (2.3)
I-28	3.22	3.29	实施例 28: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.561 (4.9); 8.983 (2.2); 8.362 (2.2); 8.359 (2.2); 4.075 (16.0); 4.032 (0.3); 4.022 (0.4); 3.323 (56.4); 3.202 (1.1); 3.184 (3.5); 3.165 (3.5); 3.147 (1.1); 2.676 (0.4); 2.671 (0.6); 2.667 (0.4); 2.511 (33.1); 2.507 (65.1); 2.502 (84.7); 2.498 (61.6); 2.494 (30.1); 2.333 (0.4); 2.329 (0.5); 2.324 (0.4); 1.355 (0.7); 1.252 (4.0); 1.233 (8.3); 1.215 (3.7); 0.008 (2.6); 0.000 (63.4); -0.008 (2.5)
I-29	2.93	3.04	实施例 29: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.302 (3.5); 8.962 (1.6); 8.959 (1.8); 8.951 (1.8); 8.947 (1.8); 8.457 (1.3); 8.437 (1.4); 8.334 (3.7); 7.856 (1.7); 7.845 (1.7); 7.836 (1.6); 7.824 (1.6); 4.092 (16.0); 3.329 (37.7); 2.526 (0.6); 2.512 (14.7); 2.508 (30.1); 2.504 (40.6); 2.499 (31.1); 2.495 (16.5); 0.000 (1.9)
I-30	2.36	2.41	实施例 30: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.307 (3.8); 8.443 (2.9); 8.305 (4.0); 8.190 (6.5); 4.008 (15.9); 3.327 (62.6); 2.995 (16.0); 2.676 (0.4); 2.671 (0.5); 2.667 (0.4); 2.511 (28.7); 2.507 (57.0); 2.502 (75.3); 2.498 (56.9); 2.334 (0.4); 2.329 (0.5); 2.325 (0.4); 0.000 (3.6)

[0671]

I-31	3.86	3.94	实施例 31: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.283 (3.4); 8.955 (2.1); 8.952 (2.1); 8.347 (2.1); 8.343 (2.2); 8.334 (3.8); 4.021 (16.0); 3.324 (17.5); 3.137 (2.1); 3.119 (3.6); 3.101 (2.2); 2.892 (1.6); 2.732 (1.3); 2.672 (0.4); 2.525 (0.7); 2.512 (20.3); 2.507 (42.4); 2.503 (57.6); 2.498 (43.7); 2.494 (22.9); 2.329 (0.4); 1.607 (1.2); 1.588 (2.4); 1.570 (2.5); 1.552 (1.4); 0.961 (4.2); 0.943 (8.6); 0.924 (3.8); 0.008 (1.3); 0.000 (42.0); -0.009 (2.2)
I-32	3.32	3.37	实施例 32: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.580 (2.3); 9.577 (2.3); 9.316 (3.9); 8.796 (2.4); 8.792 (2.4); 8.350 (4.1); 7.903 (0.5); 7.898 (0.5); 7.547 (0.5); 5.756 (2.2); 3.923 (16.0); 3.898 (2.3); 3.883 (1.8); 3.878 (2.4); 3.873 (1.8); 3.859 (2.3); 3.775 (0.8); 3.323 (27.3); 2.676 (0.3); 2.671 (0.5); 2.667 (0.3); 2.524 (1.0); 2.511 (25.7); 2.507 (52.2); 2.502 (69.6); 2.498 (51.6); 2.493 (26.0); 2.329 (0.4); 2.324 (0.3); 1.737 (1.1); 1.718 (1.9); 1.699 (2.0); 1.680 (1.2); 1.013 (4.1); 1.002 (0.9); 0.995 (8.4); 0.976 (3.8); 0.000 (9.4); -0.008 (0.4)
I-33	2.11	2.12	实施例 33: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.315 (3.7); 8.969 (1.6); 8.966 (1.8); 8.958 (1.8); 8.954 (1.7); 8.556 (1.6); 8.552 (1.7); 8.536 (1.8); 8.532 (1.7); 8.319 (4.0); 7.938 (1.7); 7.926 (1.6); 7.918 (1.6); 7.906 (1.5); 4.318 (16.0); 3.552 (0.9); 3.533 (1.0); 3.519 (1.1); 3.500 (1.1); 3.481 (0.3); 3.324 (25.2); 3.031 (1.1); 3.012 (1.2); 2.998 (1.0); 2.979 (1.0); 2.507 (37.9); 2.503 (49.7); 2.499 (37.5); 1.303 (3.8); 1.285 (8.0); 1.266 (3.7); 0.000 (5.3)
I-34	4.41	4.38	实施例 34: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.332 (3.7); 8.517 (4.3); 8.515 (4.4); 8.272 (3.7); 8.251 (3.9); 7.627 (0.5); 7.623 (0.6); 7.614 (0.4); 7.597 (0.5); 7.575 (0.4); 7.566 (0.4); 7.556 (0.4); 7.542 (2.9); 7.538 (3.4); 7.509 (2.4); 7.504 (1.7); 7.488 (2.1); 7.483 (1.8); 3.321 (35.3); 2.680 (0.4); 2.675 (0.9); 2.671 (1.2); 2.666 (0.8); 2.662 (0.4); 2.610 (16.0); 2.524 (3.5); 2.511 (65.6); 2.506 (129.9); 2.502 (168.9); 2.497 (120.0); 2.493 (56.5); 2.337 (0.4); 2.333 (0.8); 2.329 (1.1); 2.324 (0.8); 2.320 (0.4); 1.355 (1.2); 1.328 (0.4); 1.207 (0.3); 1.189 (0.7); 1.168 (2.5); 1.160 (2.3); 1.145 (0.4); 1.058 (0.5); 0.146 (0.4); 0.008 (3.6); 0.000 (97.2); -0.009 (3.2); -0.150 (0.4)
I-35	4.07	4.03	实施例 35: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.334 (5.6); 8.540 (6.8); 8.538 (6.7); 8.234 (2.7); 8.231 (2.8); 8.214 (3.0); 8.211 (2.8); 7.693 (1.0); 7.690 (1.0); 7.673 (2.6); 7.669 (2.1); 7.655 (2.3); 7.651 (2.2); 7.621 (3.9); 7.602 (2.0); 7.440 (1.8); 7.437 (1.8); 7.420 (3.0); 7.402 (1.5); 7.399 (1.4); 3.323 (126.5); 3.130 (2.0); 3.112 (6.6); 3.093 (6.7); 3.075 (2.1); 2.680 (0.5); 2.675 (1.1); 2.671 (1.5); 2.666 (1.1); 2.662 (0.5); 2.524 (4.8); 2.511 (84.8); 2.506 (166.1); 2.502 (215.2); 2.497 (153.7); 2.493 (72.9); 2.333 (1.0); 2.329 (1.4); 2.324 (1.0); 1.333 (7.5); 1.315 (16.0); 1.297 (7.2); 0.008 (1.0); 0.000 (28.0); -0.009 (0.9)
I-36	2.64	2.67	实施例 36: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.577 (2.7); 9.575 (2.7); 9.320 (4.2); 8.825 (2.8); 8.822 (2.8); 8.347 (4.5); 7.902 (0.7); 7.897 (0.7); 7.886 (0.4); 7.566 (0.3); 7.546 (0.5); 5.757 (1.3); 4.018 (1.1); 3.934 (16.0); 3.700 (15.4); 3.325 (73.6); 2.671

[0672]

			(0.7); 2.506 (74.4); 2.502 (95.9); 2.498 (76.5); 2.328 (0.6); 1.258 (0.3); 1.236 (1.0); 1.169 (0.8); 0.000 (2.4)
I-37	3.10	3.17	实施例 37: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.392 (2.2); 9.388 (2.3); 9.369 (3.8); 8.726 (2.3); 8.721 (2.4); 8.385 (3.9); 8.316 (0.5); 4.362 (16.0); 3.627 (0.9); 3.608 (1.1); 3.594 (1.1); 3.575 (1.0); 3.324 (136.2); 3.117 (1.0); 3.098 (1.2); 3.084 (1.0); 3.065 (0.9); 2.676 (0.8); 2.671 (1.1); 2.667 (0.9); 2.507 (127.4); 2.502 (169.6); 2.498 (129.7); 2.333 (0.8); 2.329 (1.1); 2.325 (0.9); 1.330 (3.8); 1.312 (8.1); 1.293 (3.6); 0.146 (0.9); 0.008 (7.7); 0.000 (196.4); -0.150 (0.9)
I-38	2.63	2.68	实施例 38: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.273 (3.9); 8.266 (4.2); 8.141 (2.4); 8.120 (3.8); 8.105 (2.9); 8.100 (3.4); 8.055 (2.4); 8.049 (2.0); 8.033 (1.5); 8.028 (1.3); 7.904 (0.8); 7.899 (0.7); 7.894 (0.5); 7.887 (0.5); 7.697 (0.3); 7.568 (0.5); 7.548 (0.8); 7.528 (0.3); 3.763 (16.0); 3.530 (0.6); 3.513 (1.3); 3.495 (1.4); 3.476 (0.6); 3.357 (0.5); 3.328 (61.7); 2.676 (0.4); 2.671 (0.5); 2.667 (0.4); 2.525 (1.3); 2.507 (57.0); 2.502 (75.7); 2.498 (56.3); 2.333 (0.3); 2.329 (0.5); 2.325 (0.3); 1.125 (3.8); 1.107 (8.1); 1.088 (3.6); 0.000 (0.6)
I-39	3.45	3.52	实施例 39: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.386 (2.2); 9.383 (2.3); 9.374 (3.8); 8.774 (2.3); 8.769 (2.3); 8.316 (0.4); 8.302 (3.8); 5.756 (0.4); 4.362 (16.0); 3.637 (0.5); 3.616 (0.9); 3.605 (0.6); 3.596 (0.6); 3.585 (1.0); 3.564 (0.6); 3.322 (68.3); 2.993 (0.6); 2.981 (0.7); 2.973 (0.7); 2.961 (1.1); 2.949 (0.7); 2.941 (0.7); 2.928 (0.6); 2.676 (0.6); 2.671 (0.8); 2.666 (0.6); 2.511 (49.6); 2.506 (97.4); 2.502 (127.7); 2.497 (95.5); 2.493 (49.9); 2.333 (0.6); 2.329 (0.8); 2.324 (0.6); 2.029 (0.5); 2.010 (0.7); 1.994 (0.8); 1.975 (0.7); 1.956 (0.4); 1.804 (0.4); 1.789 (0.6); 1.783 (0.5); 1.770 (0.6); 1.757 (0.4); 1.754 (0.4); 1.146 (3.8); 1.128 (8.0); 1.109 (3.6); 0.146 (0.8); 0.008 (8.1); 0.000 (174.8); -0.008 (10.0); -0.150 (0.8)
I-40	3.10	3.15	实施例 40: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.347 (4.8); 8.561 (5.7); 8.293 (2.2); 8.291 (2.3); 8.274 (2.4); 8.271 (2.3); 7.668 (1.0); 7.665 (1.1); 7.647 (2.2); 7.630 (1.4); 7.627 (1.3); 7.480 (1.7); 7.460 (2.8); 7.442 (1.3); 7.179 (2.9); 7.159 (2.6); 6.870 (1.5); 6.647 (0.8); 5.165 (3.3); 5.147 (6.3); 5.130 (3.6); 4.804 (0.5); 4.788 (1.2); 4.771 (1.9); 4.755 (1.2); 4.738 (0.4); 4.512 (3.8); 4.496 (6.3); 4.480 (3.3); 3.328 (53.8); 2.672 (0.6); 2.507 (73.4); 2.503 (93.5); 2.499 (70.8); 2.330 (0.6); 2.183 (2.4); 1.355 (16.0); 1.233 (0.9); 1.182 (0.6); 0.008 (3.2); 0.000 (57.9)
I-41	3.73	3.80	实施例 41: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.277 (3.9); 8.989 (2.5); 8.456 (2.5); 8.453 (2.5); 8.345 (0.3); 8.333 (4.2); 7.954 (0.5); 4.021 (0.4); 4.003 (1.1); 3.988 (16.0); 3.949 (0.4); 3.932 (1.0); 3.916 (1.4); 3.899 (1.1); 3.883 (0.4); 3.325 (35.1); 2.892 (3.7); 2.732 (3.3); 2.672 (0.3); 2.507 (40.5); 2.503 (53.7); 2.499 (41.6); 2.330 (0.4); 1.235 (14.8); 1.219 (14.7); 0.008 (1.4); 0.000 (30.8)
I-42	3.39	3.46	实施例 I-42: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.881 (0.4); 9.213 (3.4); 8.238 (3.6); 8.236 (3.6); 8.136 (0.4); 8.085 (0.7); 7.683 (0.3); 7.639 (2.8); 7.634 (2.9); 7.572 (2.4); 7.552 (3.7); 7.504 (0.5); 7.499 (0.5); 7.483 (2.1); 7.478 (2.0); 7.462 (1.4); 7.457

[0673]

			(1.3); 6.870 (0.4); 3.779 (16.0); 3.618 (0.4); 3.608 (0.3); 3.602 (1.0); 3.585 (0.4); 3.325 (20.2); 3.098 (0.6); 3.067 (1.2); 3.048 (3.9); 3.030 (4.0); 3.016 (0.9); 3.012 (1.3); 2.877 (1.1); 2.865 (1.1); 2.676 (0.4); 2.671 (0.5); 2.667 (0.4); 2.525 (1.4); 2.520 (2.1); 2.511 (30.1); 2.507 (61.5); 2.502 (81.2); 2.498 (58.8); 2.493 (28.4); 2.333 (0.4); 2.329 (0.5); 2.324 (0.4); 2.183 (0.7); 1.776 (0.4); 1.769 (0.4); 1.760 (1.2); 1.752 (0.4); 1.744 (0.4); 1.355 (5.3); 1.245 (0.8); 1.236 (0.4); 1.226 (1.7); 1.218 (0.5); 1.208 (0.8); 1.193 (4.1); 1.175 (8.7); 1.156 (3.9); 0.146 (0.4); 0.008 (2.9); 0.000 (88.8); -0.009 (3.1); -0.150 (0.4)
I-43	2.61	2.69	实施例 I-43: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.259 (3.8); 8.259 (4.0); 8.123 (6.1); 8.118 (3.1); 8.107 (2.5); 8.102 (1.5); 7.945 (2.9); 7.939 (0.8); 7.929 (0.7); 7.923 (2.3); 5.757 (11.4); 3.742 (16.0); 3.600 (0.7); 3.581 (2.2); 3.563 (2.2); 3.545 (0.7); 3.329 (38.9); 2.671 (0.4); 2.525 (1.2); 2.511 (23.7); 2.507 (48.0); 2.502 (63.6); 2.498 (47.5); 2.494 (24.1); 2.329 (0.4); 1.146 (3.7); 1.128 (8.2); 1.109 (3.6); 0.008 (0.3); 0.000 (9.3); -0.008 (0.4)
I-44	2.36	2.45	实施例 I-44: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.270 (3.8); 8.317 (0.5); 8.273 (4.1); 8.022 (2.9); 8.016 (3.1); 7.986 (2.2); 7.966 (3.6); 7.905 (2.1); 7.899 (1.9); 7.884 (1.3); 7.879 (1.2); 3.969 (16.0); 3.377 (1.0); 3.359 (1.3); 3.344 (1.9); 3.329 (150.3); 3.307 (0.6); 2.945 (1.1); 2.927 (1.2); 2.912 (1.0); 2.893 (0.9); 2.676 (0.9); 2.671 (1.2); 2.667 (0.9); 2.524 (3.1); 2.507 (141.2); 2.502 (185.0); 2.498 (135.5); 2.333 (0.9); 2.329 (1.2); 2.325 (0.9); 1.179 (3.8); 1.160 (8.2); 1.142 (3.7); 0.008 (2.3); 0.000 (70.9); -0.009 (2.6); -0.150 (0.3)
I-45		2.53	实施例 I-45: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.295 (3.9); 8.364 (3.2); 8.342 (3.4); 8.292 (4.1); 7.347 (3.4); 7.325 (3.3); 4.015 (1.0); 3.987 (16.0); 3.922 (15.6); 3.910 (1.3); 3.733 (1.0); 3.714 (3.4); 3.695 (3.4); 3.677 (1.0); 3.506 (0.3); 3.331 (66.6); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.507 (58.9); 2.503 (75.4); 2.498 (56.9); 2.334 (0.4); 2.329 (0.5); 2.325 (0.4); 2.087 (2.0); 1.234 (0.8); 1.203 (3.6); 1.185 (7.9); 1.166 (3.5); 0.008 (2.1); 0.000 (43.3)
I-46	2.92	2.98	实施例 I-46: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.269 (4.1); 8.592 (1.8); 8.590 (1.9); 8.581 (1.9); 8.578 (1.8); 8.306 (4.3); 8.094 (1.7); 8.092 (1.7); 8.074 (1.9); 8.071 (1.8); 7.955 (0.8); 7.642 (1.6); 7.631 (1.6); 7.622 (1.5); 7.610 (1.5); 3.979 (16.0); 3.334 (9.6); 3.046 (1.2); 3.027 (3.8); 3.009 (3.9); 2.991 (1.3); 2.893 (4.9); 2.734 (4.4); 2.509 (22.7); 2.505 (28.6); 2.501 (21.4); 1.220 (4.2); 1.202 (8.6); 1.184 (4.1); 0.000 (4.6)
I-47	4.02	4.10	实施例 I-47: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.308 (3.5); 8.964 (2.1); 8.961 (2.1); 8.355 (3.9); 8.353 (3.9); 8.341 (2.2); 8.338 (2.2); 8.317 (0.3); 4.030 (16.0); 3.328 (183.2); 3.184 (1.1); 3.165 (3.5); 3.147 (3.6); 3.129 (1.1); 2.676 (0.8); 2.671 (1.1); 2.667 (0.8); 2.525 (2.5); 2.520 (3.8); 2.511 (53.3); 2.507 (109.8); 2.502 (147.2); 2.498 (110.1); 2.494 (55.4); 2.334 (0.7); 2.329 (1.0); 2.325 (0.7); 1.235 (4.2); 1.217 (8.3); 1.198 (3.8); 0.146 (1.1); 0.008 (8.0); 0.000 (229.8); -0.009 (9.5); -0.150 (1.1)
I-48	2.64	2.70	实施例 I-48: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO):

[0674]

			δ = 9.337 (2.2); 9.324 (2.3); 9.295 (4.0); 8.366 (2.9); 8.353 (2.8); 8.273 (4.3); 5.757 (0.8); 3.919 (16.0); 3.894 (0.7); 3.879 (1.3); 3.862 (1.3); 3.327 (92.4); 2.676 (0.6); 2.671 (0.8); 2.667 (0.6); 2.507 (88.5); 2.502 (113.9); 2.498 (86.6); 2.333 (0.6); 2.329 (0.8); 2.325 (0.6); 1.243 (3.6); 1.224 (7.4); 1.206 (3.4); 0.146 (0.6); 0.008 (6.3); 0.000 (128.4); -0.150 (0.6)
I-49	1.99	2.05	实施例 I-49: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 11.328 (3.1); 9.295 (4.3); 8.532 (1.7); 8.509 (4.8); 8.487 (4.4); 8.465 (1.5); 8.318 (0.6); 8.304 (4.7); 3.876 (16.0); 3.847 (0.7); 3.658 (1.1); 3.639 (3.5); 3.621 (3.5); 3.602 (1.1); 3.331 (78.4); 2.892 (0.3); 2.676 (1.0); 2.672 (1.3); 2.668 (1.0); 2.565 (0.4); 2.507 (157.3); 2.503 (200.0); 2.498 (150.8); 2.344 (0.8); 2.334 (1.0); 2.329 (1.4); 2.169 (15.8); 1.989 (1.1); 1.234 (0.5); 1.184 (3.8); 1.175 (1.3); 1.166 (8.3); 1.148 (3.7); 0.008 (0.9); 0.000 (19.7)
I-50	2.27	2.39	实施例 I-50: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 10.770 (2.6); 9.256 (3.9); 8.290 (1.9); 8.277 (4.3); 8.268 (2.5); 8.242 (0.7); 8.115 (3.0); 8.093 (2.4); 8.063 (0.4); 4.456 (1.9); 4.038 (0.6); 4.020 (0.7); 3.979 (16.0); 3.332 (83.1); 2.966 (1.2); 2.948 (4.0); 2.929 (4.1); 2.911 (1.3); 2.676 (0.4); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.507 (62.3); 2.503 (81.2); 2.498 (61.4); 2.334 (0.4); 2.330 (0.5); 2.325 (0.4); 2.184 (1.9); 2.119 (15.2); 1.989 (2.6); 1.193 (0.7); 1.172 (4.5); 1.154 (9.1); 1.135 (4.2); 0.008 (2.6); 0.000 (55.6); -0.008 (3.1)
I-51		2.48	实施例 I-51: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.259 (4.5); 9.210 (2.4); 9.198 (2.5); 8.278 (4.7); 8.276 (4.8); 8.226 (3.2); 8.214 (3.1); 5.757 (2.5); 3.965 (0.7); 3.946 (0.8); 3.932 (0.8); 3.920 (0.7); 3.914 (0.8); 3.795 (16.0); 3.375 (0.6); 3.356 (0.8); 3.328 (59.8); 3.305 (0.3); 2.676 (0.4); 2.672 (0.5); 2.667 (0.4); 2.525 (1.2); 2.511 (27.2); 2.507 (56.1); 2.502 (75.0); 2.498 (55.5); 2.494 (27.5); 2.334 (0.4); 2.329 (0.5); 2.325 (0.4); 1.264 (3.7); 1.245 (7.9); 1.227 (3.8); 0.008 (1.2); 0.000 (39.0); -0.008 (1.4)
I-52	2.51	2.61	实施例 I-52: ^1H -NMR (601.6 MHz, CD_3CN): δ = 9.321 (2.5); 8.780 (3.9); 8.736 (2.6); 7.746 (3.8); 3.824 (1.3); 3.809 (16.0); 3.799 (3.9); 3.787 (1.3); 2.141 (2.3); 1.965 (10.4); 1.957 (0.4); 1.944 (3.9); 1.940 (5.2); 1.937 (3.8); 1.933 (2.0); 1.297 (3.8); 1.285 (7.6); 1.273 (3.7); 0.000 (3.3)
I-53		3.12	实施例 I-53: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.242 (3.5); 8.270 (3.7); 8.119 (0.4); 8.064 (2.9); 8.042 (3.1); 7.123 (3.3); 7.101 (3.1); 4.012 (16.0); 3.959 (0.4); 3.909 (1.6); 3.899 (16.0); 3.332 (95.1); 2.942 (1.2); 2.923 (3.9); 2.905 (3.9); 2.887 (1.3); 2.677 (0.4); 2.672 (0.6); 2.668 (0.4); 2.525 (1.6); 2.511 (32.5); 2.507 (64.4); 2.503 (84.3); 2.499 (63.2); 2.334 (0.4); 2.330 (0.6); 2.325 (0.4); 1.990 (0.8); 1.175 (0.5); 1.144 (4.1); 1.126 (8.6); 1.107 (4.0); 0.008 (2.3); 0.000 (60.3); -0.008 (3.0)
I-54	3.07	3.16	实施例 I-54: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.293 (3.9); 8.987 (2.7); 8.490 (2.7); 8.335 (4.1); 5.757 (0.6); 4.713 (1.2); 4.699 (2.4); 4.685 (1.2); 4.595 (1.1); 4.581 (2.3); 4.567 (1.3); 4.041 (16.0); 3.581 (1.1); 3.567 (2.2); 3.553 (1.1); 3.521 (1.2); 3.507

[0675]

			(2.2); 3.493 (1.1); 3.327 (105.4); 2.671 (0.8); 2.506 (88.1); 2.502 (120.1); 2.498 (96.8); 2.333 (0.6); 2.329 (0.8); 1.234 (0.4); 0.146 (0.4); 0.008 (2.7); 0.000 (84.4); -0.150 (0.4)
I-55	3.01	3.12	实施例 I-55: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 8.956 (3.9); 8.953 (4.0); 8.942 (2.0); 8.940 (2.0); 8.317 (2.1); 7.904 (3.7); 7.902 (3.7); 3.950 (16.0); 3.332 (109.0); 3.172 (1.0); 3.154 (3.3); 3.135 (3.4); 3.117 (1.0); 2.676 (0.3); 2.672 (0.5); 2.667 (0.4); 2.525 (1.2); 2.520 (1.8); 2.512 (26.2); 2.507 (53.9); 2.503 (71.3); 2.498 (52.0); 2.494 (25.3); 2.334 (0.3); 2.330 (0.5); 2.325 (0.4); 1.251 (0.5); 1.232 (5.1); 1.214 (7.9); 1.195 (3.5); 1.103 (0.3); 0.000 (6.1)
I-56	1.56	1.61	实施例 I-56: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.502 (3.9); 9.497 (3.4); 9.306 (4.1); 8.900 (4.0); 8.895 (3.4); 8.645 (1.9); 8.322 (4.5); 8.057 (1.9); 3.892 (16.0); 3.843 (1.3); 3.825 (3.8); 3.806 (3.7); 3.788 (1.1); 3.332 (180.7); 2.676 (0.9); 2.672 (1.1); 2.667 (0.8); 2.507 (135.9); 2.503 (156.6); 2.498 (111.5); 2.334 (0.9); 2.330 (1.0); 2.325 (0.7); 1.298 (0.5); 1.259 (1.0); 1.235 (5.5); 1.217 (8.5); 1.198 (3.8); 0.000 (14.4); -0.062 (0.6)
I-57	2.82	2.89	实施例 I-57: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.596 (2.3); 9.593 (2.2); 9.330 (3.8); 9.320 (0.5); 8.830 (2.3); 8.826 (2.2); 8.353 (4.1); 4.994 (1.0); 4.982 (1.5); 4.969 (1.1); 4.877 (1.0); 4.865 (1.5); 4.852 (1.2); 4.493 (1.1); 4.480 (1.5); 4.468 (1.0); 4.427 (1.2); 4.414 (1.5); 4.402 (1.0); 3.957 (16.0); 3.947 (1.6); 3.919 (0.4); 3.813 (0.3); 3.328 (182.7); 2.676 (0.7); 2.671 (1.0); 2.667 (0.7); 2.663 (0.4); 2.524 (3.6); 2.511 (61.5); 2.507 (120.1); 2.502 (156.5); 2.498 (114.9); 2.493 (57.0); 2.333 (0.7); 2.329 (1.0); 2.325 (0.7); 2.074 (0.5); 1.235 (0.6); 0.008 (2.3); 0.000 (63.1); -0.008 (2.5)
I-58		2.19	实施例 I-58: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.553 (2.2); 9.550 (2.2); 9.320 (3.9); 8.786 (2.4); 8.781 (2.4); 8.336 (4.1); 5.755 (1.0); 5.119 (1.2); 5.106 (2.9); 5.093 (1.3); 4.066 (1.6); 4.052 (3.3); 4.038 (2.1); 3.919 (16.0); 3.869 (1.1); 3.855 (2.7); 3.842 (2.5); 3.828 (0.9); 3.400 (0.4); 3.393 (0.4); 3.384 (0.5); 3.345 (268.1); 3.309 (0.6); 2.672 (0.4); 2.526 (1.1); 2.512 (22.7); 2.508 (46.1); 2.503 (61.2); 2.499 (45.2); 2.494 (22.6); 2.330 (0.4); 0.000 (0.6)
I-59	2.31	2.41	实施例 I-59: $^1\text{H-NMR}$ (600.1 MHz, CD_3CN): δ = 9.085 (2.6); 8.843 (1.4); 8.842 (1.6); 8.840 (1.5); 8.333 (1.7); 8.331 (1.6); 8.165 (2.9); 5.447 (1.4); 3.979 (16.0); 3.725 (0.9); 3.715 (2.8); 3.705 (2.9); 3.695 (1.0); 3.459 (0.9); 3.449 (1.8); 3.439 (0.8); 3.177 (2.4); 3.167 (4.3); 3.157 (2.2); 2.145 (5.7); 1.957 (0.5); 1.953 (0.6); 1.949 (3.0); 1.945 (5.2); 1.941 (7.5); 1.937 (5.0); 1.933 (2.5)
I-60	1.76	1.77	实施例 I-60: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.262 (4.0); 8.968 (3.2); 8.963 (3.3); 8.415 (1.6); 8.354 (3.0); 8.350 (3.1); 8.303 (4.3); 7.862 (1.6); 4.008 (16.0); 3.331 (33.2); 3.113 (1.1); 3.095 (3.7); 3.076 (3.8); 3.058 (1.2); 2.508 (35.4); 2.504 (46.2); 2.499 (34.8); 1.246 (4.0); 1.228 (8.5); 1.209 (3.9); 0.008 (1.7); 0.000 (46.1); -0.008 (2.2)
I-61	2.63	2.71	实施例 I-61: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

[0676]

			δ = 9.343 (3.7); 8.973 (1.6); 8.969 (1.8); 8.961 (1.8); 8.957 (1.8); 8.559 (1.6); 8.555 (1.7); 8.539 (1.8); 8.535 (1.8); 8.347 (4.0); 8.345 (4.0); 7.941 (1.7); 7.929 (1.6); 7.921 (1.6); 7.909 (1.6); 4.320 (16.0); 3.561 (1.0); 3.542 (1.0); 3.528 (1.1); 3.509 (1.1); 3.490 (0.3); 3.330 (33.2); 3.048 (1.1); 3.030 (1.2); 3.015 (1.0); 2.997 (1.0); 2.677 (0.4); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.525 (1.3); 2.507 (56.6); 2.503 (75.2); 2.499 (56.4); 2.334 (0.4); 2.330 (0.5); 2.325 (0.4); 1.301 (3.8); 1.282 (8.2); 1.264 (3.7); 0.146 (0.5); 0.008 (4.0); 0.000 (110.8); -0.008 (5.6); -0.150 (0.5)
I-62	2.15	2.17	实施例 I-62: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.207 (3.4); 8.318 (0.5); 8.194 (3.7); 8.192 (3.6); 8.062 (1.6); 8.059 (1.7); 8.042 (2.2); 8.039 (2.2); 7.947 (1.8); 7.928 (2.7); 7.908 (1.6); 7.735 (2.0); 7.732 (2.1); 7.716 (1.8); 7.713 (1.7); 3.742 (16.0); 3.593 (1.0); 3.574 (3.5); 3.556 (3.6); 3.537 (1.2); 3.329 (74.8); 2.676 (0.7); 2.671 (0.9); 2.667 (0.7); 2.662 (0.4); 2.525 (2.4); 2.520 (3.6); 2.511 (50.5); 2.507 (105.6); 2.502 (140.5); 2.498 (101.4); 2.493 (48.8); 2.334 (0.6); 2.329 (0.9); 2.324 (0.6); 2.086 (0.7); 1.235 (1.3); 1.184 (4.0); 1.166 (9.0); 1.147 (3.9); 1.140 (0.6); 0.146 (0.7); 0.008 (5.0); 0.000 (161.5); -0.009 (5.9); -0.150 (0.7)
I-63	3.62	3.75	实施例 I-63: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.396 (5.6); 8.728 (2.2); 8.723 (2.3); 8.416 (4.1); 8.414 (3.9); 8.318 (0.5); 4.362 (16.0); 3.635 (0.9); 3.617 (1.0); 3.602 (1.1); 3.583 (1.0); 3.332 (165.3); 3.134 (1.0); 3.116 (1.2); 3.101 (1.0); 3.083 (1.0); 2.676 (0.8); 2.672 (1.1); 2.667 (0.8); 2.525 (2.6); 2.511 (62.1); 2.507 (126.3); 2.503 (165.5); 2.498 (121.7); 2.494 (60.8); 2.334 (0.8); 2.329 (1.1); 2.325 (0.8); 1.327 (3.7); 1.308 (8.1); 1.290 (3.6); 0.146 (0.4); 0.008 (3.1); 0.000 (96.0); -0.008 (4.1); -0.150 (0.4)
I-64	3.95	3.93	实施例 I-64: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.275 (2.6); 9.271 (2.5); 8.943 (4.3); 8.584 (2.6); 8.580 (2.6); 8.318 (0.5); 7.701 (3.0); 7.680 (3.9); 7.548 (3.8); 7.527 (3.0); 7.410 (4.6); 3.890 (16.0); 3.329 (75.4); 3.140 (1.3); 3.122 (4.2); 3.104 (4.3); 3.086 (1.4); 2.676 (0.9); 2.671 (1.2); 2.667 (0.9); 2.507 (140.3); 2.502 (179.9); 2.498 (134.5); 2.334 (0.9); 2.329 (1.2); 2.325 (0.9); 1.281 (4.6); 1.263 (9.7); 1.245 (4.5); 0.146 (0.4); 0.008 (3.6); 0.000 (84.0); -0.150 (0.4)
I-65	4.31	4.37	实施例 I-65: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.217 (3.1); 9.076 (4.1); 9.074 (4.1); 8.959 (2.3); 8.956 (2.3); 8.334 (2.3); 8.318 (1.7); 8.288 (3.7); 8.211 (4.1); 8.209 (4.1); 5.758 (1.1); 4.005 (16.0); 3.328 (226.4); 3.189 (1.1); 3.171 (3.5); 3.153 (3.6); 3.134 (1.1); 2.676 (2.7); 2.671 (3.8); 2.667 (2.8); 2.525 (9.3); 2.520 (14.6); 2.511 (211.4); 2.507 (434.4); 2.502 (573.8); 2.498 (421.2); 2.493 (209.9); 2.333 (2.7); 2.329 (3.7); 2.324 (2.8); 1.258 (0.3); 1.243 (4.1); 1.225 (8.8); 1.206 (3.9); 1.148 (0.3); 0.146 (1.3); 0.008 (9.7); 0.000 (308.8); -0.008 (13.1); -0.150 (1.4)
I-66	3.42	3.50	实施例 I-66: ^1H -NMR (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.243 (3.5); 8.317 (0.4); 8.274 (3.7); 8.069 (2.9); 8.047 (3.1); 7.116 (3.3); 7.094 (3.2); 4.017 (0.4); 4.000 (16.0); 3.893 (15.8); 3.329 (74.5); 2.884 (2.3); 2.867 (3.7); 2.848 (2.4); 2.676 (0.7); 2.671 (0.9); 2.667 (0.7); 2.525 (2.3); 2.511 (50.8); 2.507 (105.0); 2.502 (139.6); 2.498

[0677]

			(102.9); 2.494 (51.4); 2.334 (0.6); 2.329 (0.9); 2.325 (0.7); 1.496 (1.2); 1.478 (2.4); 1.460 (2.5); 1.442 (1.4); 0.875 (4.2); 0.857 (8.4); 0.838 (3.7); 0.008 (0.8); 0.000 (28.2); -0.008 (1.2)
I-67	2.70	2.75	实施例 I-67: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10.028 (0.5); 9.850 (0.4); 9.268 (0.7); 9.248 (3.0); 8.317 (1.0); 8.302 (0.7); 8.262 (3.1); 8.236 (0.6); 8.194 (0.5); 8.119 (1.3); 8.097 (0.7); 8.026 (2.6); 8.004 (2.6); 7.996 (0.5); 7.978 (0.6); 7.181 (0.8); 7.159 (0.6); 7.133 (2.8); 7.111 (2.7); 4.442 (2.5); 4.071 (13.8); 4.017 (3.3); 4.014 (3.6); 3.959 (1.9); 3.910 (16.0); 3.329 (346.6); 2.881 (1.4); 2.869 (1.4); 2.676 (1.7); 2.671 (2.3); 2.667 (1.7); 2.525 (5.8); 2.511 (128.4); 2.507 (263.1); 2.502 (348.1); 2.498 (256.2); 2.494 (127.6); 2.422 (14.2); 2.334 (1.7); 2.329 (2.3); 2.325 (1.7); 1.989 (0.9); 1.234 (0.3); 1.175 (0.5); 0.146 (0.4); 0.008 (3.2); 0.000 (99.9); -0.008 (3.8); -0.150 (0.5)
I-68	2.46	2.50	实施例 I-68: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.319 (4.1); 9.142 (1.6); 9.139 (1.9); 9.130 (1.8); 9.126 (1.9); 8.582 (1.6); 8.578 (1.8); 8.562 (1.9); 8.558 (1.9); 8.328 (4.3); 8.024 (1.7); 8.012 (1.7); 8.003 (1.6); 7.991 (1.6); 3.870 (16.0); 3.802 (1.0); 3.783 (3.5); 3.765 (3.6); 3.746 (1.1); 3.333 (44.0); 2.676 (0.3); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.507 (56.6); 2.503 (74.8); 2.499 (56.9); 2.330 (0.5); 1.209 (3.7); 1.191 (8.1); 1.172 (3.6); 0.008 (1.1); 0.000 (28.7)
I-69	4.32	4.37	实施例 I-69: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.080 (4.3); 9.078 (4.2); 8.959 (2.4); 8.956 (2.4); 8.873 (1.8); 8.871 (2.0); 8.867 (2.1); 8.865 (1.8); 8.337 (2.4); 8.334 (2.4); 8.181 (4.2); 8.180 (4.2); 7.062 (2.5); 7.056 (2.5); 4.007 (16.0); 3.330 (22.5); 3.189 (1.1); 3.170 (3.7); 3.152 (3.7); 3.133 (1.2); 2.677 (0.3); 2.672 (0.5); 2.668 (0.3); 2.526 (1.2); 2.512 (26.3); 2.508 (53.3); 2.503 (70.1); 2.499 (51.8); 2.495 (26.3); 2.330 (0.4); 2.326 (0.3); 2.077 (0.6); 1.244 (4.0); 1.225 (8.7); 1.207 (3.9); 0.008 (1.3); 0.000 (37.3); -0.008 (1.8)
I-70	3.24	3.29	实施例 I-70: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.272 (4.0); 9.057 (2.0); 9.044 (2.1); 8.309 (4.2); 8.135 (2.8); 8.122 (2.7); 4.021 (0.4); 3.846 (16.0); 3.328 (22.9); 2.736 (1.1); 2.717 (3.4); 2.699 (3.5); 2.680 (1.3); 2.507 (37.7); 2.503 (49.4); 2.499 (37.9); 1.990 (1.3); 1.397 (1.1); 1.193 (0.3); 1.176 (0.7); 1.158 (0.4); 0.985 (4.0); 0.966 (8.1); 0.948 (3.8); 0.008 (1.7); 0.000 (44.7); -0.008 (2.1)
I-71		2.93	实施例 I-71: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.293 (4.1); 8.368 (3.1); 8.345 (3.3); 8.299 (4.3); 7.342 (3.4); 7.320 (3.2); 5.758 (0.9); 4.017 (0.4); 3.985 (16.0); 3.918 (15.5); 3.716 (2.2); 3.701 (1.9); 3.696 (2.5); 3.692 (1.8); 3.677 (2.2); 3.330 (25.0); 2.676 (0.4); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.507 (54.4); 2.503 (69.4); 2.499 (51.7); 2.330 (0.5); 2.326 (0.3); 1.668 (1.1); 1.649 (2.0); 1.630 (2.0); 1.611 (1.2); 1.235 (0.7); 0.993 (4.1); 0.974 (8.2); 0.956 (3.7); 0.000 (2.4)
I-72	2.26	2.32	实施例 I-72: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.581 (3.0); 9.576 (3.0); 9.312 (4.1); 9.070 (3.3); 9.065 (3.2); 8.716 (1.0); 8.704 (0.9); 8.335 (4.3); 8.091 (0.4); 7.660 (0.6); 7.645 (0.8); 7.641 (0.7); 7.626 (0.6); 3.916 (16.0); 3.872 (1.3); 3.854 (3.8); 3.835 (3.9); 3.817 (1.4); 3.736 (0.6); 3.694 (0.7); 3.626 (0.8); 3.613 (0.8); 2.671 (1.0); 2.506 (105.6); 2.502 (135.4); 2.498 (103.6); 2.333 (0.7);

[0678]

			2.329 (0.9); 1.989 (0.7); 1.298 (0.6); 1.252 (4.0); 1.234 (9.7); 1.215 (3.9); 1.193 (0.3); 1.175 (0.5); 0.000 (3.0)
I-73	2.20	2.25	<p>实施例 I-73: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9.297 (3.6); 9.268 (0.9); 9.255 (0.6); 9.208 (0.4); 8.404 (3.2); 8.382 (3.4); 8.317 (0.4); 8.298 (3.9); 8.238 (0.6); 8.119 (0.8); 8.106 (0.4); 8.097 (0.9); 8.084 (0.4); 8.024 (0.5); 8.022 (0.5); 7.996 (0.4); 7.975 (0.4); 7.352 (3.6); 7.330 (3.5); 7.181 (0.8); 7.159 (0.8); 7.087 (0.4); 7.069 (0.4); 7.067 (0.4); 5.758 (2.8); 4.564 (1.5); 4.442 (3.0); 4.115 (0.7); 4.015 (4.7); 3.988 (16.0); 3.931 (15.4); 3.909 (3.9); 3.568 (0.8); 3.544 (14.4); 3.331 (131.8); 2.676 (0.7); 2.672 (0.9); 2.667 (0.7); 2.525 (2.7); 2.511 (52.5); 2.507 (106.0); 2.503 (139.4); 2.498 (102.4); 2.494 (51.6); 2.334 (0.6); 2.329 (0.9); 2.325 (0.7); 1.259 (0.5); 1.234 (1.5); 0.000 (5.6)</p>
I-74	3.36	3.49	<p>实施例 I-74: ¹H-NMR (601.6 MHz, CD₃CN):</p> <p>δ= 8.905 (3.0); 8.903 (3.0); 8.852 (1.6); 8.850 (1.6); 8.500 (1.9); 8.313 (1.5); 8.311 (2.1); 8.309 (1.4); 8.183 (1.7); 8.181 (1.7); 7.962 (3.4); 7.961 (3.4); 4.001 (16.0); 3.940 (0.4); 3.124 (1.1); 3.111 (3.4); 3.099 (3.5); 3.087 (1.2); 2.639 (0.7); 2.184 (55.7); 2.109 (1.2); 2.005 (2.2); 1.998 (195.7); 1.989 (2.7); 1.985 (1.8); 1.981 (10.0); 1.977 (18.2); 1.973 (26.5); 1.969 (18.0); 1.965 (9.0); 1.882 (1.2); 1.419 (0.4); 1.404 (0.7); 1.373 (0.6); 1.330 (4.1); 1.318 (9.0); 1.309 (1.6); 1.305 (5.2); 1.301 (3.4); 0.914 (0.6)</p>
I-75	2.84	2.94	<p>实施例 I-75: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9.582 (2.6); 9.107 (4.5); 8.797 (2.6); 8.794 (2.8); 8.761 (3.5); 8.668 (2.9); 8.361 (4.6); 8.314 (0.3); 5.754 (2.9); 3.939 (1.0); 3.920 (3.5); 3.897 (16.0); 3.883 (1.4); 3.316 (65.0); 2.675 (0.8); 2.671 (1.1); 2.666 (0.9); 2.506 (121.1); 2.502 (165.0); 2.497 (131.6); 2.333 (0.7); 2.328 (1.1); 2.324 (0.9); 1.988 (0.8); 1.272 (3.7); 1.253 (8.2); 1.235 (4.5); 1.175 (0.4); 0.146 (0.5); 0.008 (3.6); 0.000 (102.8); -0.150 (0.5)</p>
I-76	3.73	3.84	<p>实施例 I-76: ¹H-NMR (601.6 MHz, CD₃CN):</p> <p>δ= 9.334 (1.1); 9.333 (1.2); 9.331 (1.2); 9.329 (1.1); 9.015 (1.4); 9.014 (1.7); 8.867 (2.5); 8.865 (2.3); 8.751 (1.2); 8.750 (1.3); 8.747 (1.3); 8.287 (2.6); 8.286 (2.3); 8.036 (1.9); 5.446 (0.6); 3.879 (0.9); 3.867 (16.0); 3.855 (3.0); 3.842 (0.9); 2.129 (16.5); 1.964 (0.3); 1.955 (0.9); 1.951 (1.2); 1.947 (9.5); 1.943 (17.4); 1.939 (24.5); 1.935 (16.4); 1.931 (8.6); 1.313 (3.1); 1.300 (6.6); 1.288 (3.1); 1.270 (0.6); 0.005 (0.6); 0.000 (19.1); -0.006 (0.7)</p>
I-77	3.81	3.90	<p>实施例 I-77: ¹H-NMR (601.6 MHz, CD₃CN):</p> <p>δ= 9.333 (1.3); 9.332 (1.5); 9.330 (1.5); 8.871 (3.2); 8.869 (3.1); 8.750 (1.6); 8.748 (1.6); 8.736 (1.3); 8.734 (1.4); 8.731 (1.4); 8.730 (1.2); 8.250 (3.0); 8.249 (3.0); 6.869 (1.7); 6.865 (1.7); 5.446 (0.7); 3.884 (1.1); 3.871 (4.7); 3.869 (16.0); 3.859 (3.6); 3.847 (1.1); 2.133 (5.1); 1.956 (0.3); 1.952 (0.4); 1.948 (3.5); 1.944 (6.3); 1.940 (9.0); 1.936 (6.1); 1.932 (3.2); 1.314 (3.5); 1.302 (7.5); 1.290 (3.6); 1.285 (0.4); 1.267 (0.5); 0.000 (5.6)</p>

[0679] 用途实施例

[0680] 猫栉头蚤 - 体外接触测试

[0681] 对于试管的涂覆,首先将 9mg 的活性成分溶解在 1ml 分析纯丙酮中,然后用分析纯丙酮稀释到所需的浓度。将 250 μ l 溶液通过定轨摇床(以 30rpm 的摇摆旋转速度摇摆 2h)的旋转和摇摆均匀分布在 25ml 试管内壁和底部上。使用 900ppm 的活性成分溶液和 44.7cm² 内表面,得到均匀分布,获得以面积计的 5 μ g/cm² 的剂量。

[0682] 当溶剂蒸发出后,试管中放入 5-10 只成年猫蚤(猫栉头蚤),用带孔的塑料盖密封,在室温和环境湿度下水平放置培育。48h 后,测定功效。为此,将试管垂直放置,敲击该蚤使之到试管底部。将在试管底部保持静止或以不协调方式活动的蚤视为死亡或将要死亡。

[0683] 如果在本测试中在 5 μ g/cm² 施用率下获得至少 80% 的功效,则该物质显示出抗猫栉头蚤良好的功效。100% 的功效意指所有跳蚤均死亡或将要死亡。0% 的功效意指没有跳蚤受到伤害。

[0684] 在本测试中,例如,来自制备实施例的下列化合物在施用率为 5 μ g/cm² 下显示出 100% 的功效:I-18、I-21。

[0685] 微小牛蜱 (Boophilus microplus) – 注射测试 (BOOPMI inj)

[0686] 溶剂:二甲基亚砜

[0687] 为制备合适的活性成分制剂,将 10mg 的活性成分与 0.5ml 的溶剂混合,并用溶剂将浓缩物稀释到所需浓度。

[0688] 将 1 μ l 的活性成分溶液注射到 5 只过饱的成年雌牛蜱(微小牛蜱)的腹腔中。将动物转移到盘子中,放在气候控制室中。

[0689] 7 天后通过受精卵的产卵来评估功效。将不明显可育性的卵储存在气候控制箱中,直到约 42 天后幼虫孵化出来。100% 的功效意指没有蜱虫产生任何受精卵,0% 的功效意指所有卵都是能育的。

[0690] 在本测试中,例如,来自制备实施例的下列化合物在施用率为 20 μ g/动物下显示出 80% 的功效:I-21。

[0691] 猫栉头蚤 – 口服测试 (CTECFE)

[0692] 溶剂:二甲基亚砜

[0693] 为了制备合适的活性成分制剂,将 10mg 的活性成分与 0.5ml 的二甲基亚砜混合。用柠檬酸牛血稀释,得到所需浓度。

[0694] 将约 20 只未进食的成年猫蚤(猫栉头蚤)放置到顶部和底部用纱布密封的容器(chamber)内。将底部用石蜡膜密封的金属圆筒放置在容器中。圆筒中含有血液/活性成分制剂,其可以由跳蚤透过石蜡膜而吸收。

[0695] 2 天后,测定以%计的杀死情况。100% 意指所有跳蚤都已被杀死,0% 意指没有跳蚤被杀死。

[0696] 在本测试中,例如,来自制备实施例的下列化合物在施用率为 100ppm 下显示出 90% 的功效:I-21。

[0697] 铜绿蝇测试 (LUCICU)

[0698] 溶剂:二甲基亚砜

[0699] 为了制备合适的活性成分制剂,将 10mg 的活性成分与 0.5ml 二甲基亚砜混合,并用水将浓缩物稀释到所需浓度。

[0700] 将约 20 只澳大利亚绵羊绿头蝇 (Australian sheep blowfly) (铜绿蝇) 的 L1 幼虫转移到含有切碎的马肉和所需浓度的活性成分制剂的测试容器中。

[0701] 2 天后,测定以%计的杀死情况。100%意指所有幼虫都被杀死,0%意指没有幼虫被杀死。

[0702] 在本测试中,例如,来自制备实施例的下列化合物在施用率为 100ppm 下显示出 100%的功效:I-18、I-21。

[0703] 家蝇测试 (MUSCDO)

[0704] 溶剂:二甲基亚砷

[0705] 为制备合适的活性成分制剂,将 10mg 的活性成分与 0.5ml 的二甲基亚砷混合,并用水将浓缩物稀释到所需浓度。

[0706] 在含有用糖溶液处理的海绵和所需浓度的活性成分制剂的容器放入 10 只成年家蝇(家蝇)。

[0707] 2 天后,测定以%计的杀死情况。100%意指所有家蝇都被杀死,0%意指没有家蝇被杀死。

[0708] 在本测试中,例如,来自制备实施例的下列化合物在施用率为 20ppm 下显示出 95%的功效:I-21。

[0709] 桃蚜 - 喷雾测试 (MYZUPE)

[0710] 溶剂:78 重量份的丙酮

[0711] 1.5 重量份的二甲基甲酰胺

[0712] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0713] 为了制备合适的活性成分制剂,使用上述重量份的溶剂来溶解 1 重量份的活性成分,用含有浓度为 1000ppm 乳化剂的水调节直到获得所需浓度。为了进一步得到测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。

[0714] 在感染所有阶段的绿桃蚜(桃蚜)的大白菜(白菜 (Brassica pekinensis)) 叶片的叶面上喷洒具有所需浓度的活性成分制剂。

[0715] 6 天后,测定以%计的功效。100%意指所有蚜虫都被杀死,0%意指没有蚜虫被杀死。

[0716] 在本测试中,例如,来自制备实施例的下列化合物在施用率为 500g/ha 下显示出 100%的功效:I-10、I-13、I-18、I-22、I-23、I-24、I-43、I-44、I-48、I-52。

[0717] 在本测试中,例如,来自制备实施例的下列化合物在施用率为 500g/ha 下显示出 90%的功效:I-4、I-12、I-14、I-17、I-18、I-19、I-21、I-38、I-42、I-45、I-46、I-49、I-50、I-51、I-56、I-61、I-68。

[0718] 在本测试中,例如,来自制备实施例的下列化合物在施用率为 20g/ha 下显示出 90%的功效:I-39。

[0719] 辣根猿叶甲 - 喷雾测试 (PHAECO)

[0720] 溶剂:78 重量份的丙酮

[0721] 1.5 重量份的二甲基甲酰胺

[0722] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0723] 为了制备合适的活性成分制剂,使用上述重量份的溶剂来溶解 1 重量份的活性成

分,用含有浓度为 1000ppm 乳化剂的水调节至得到所需浓度。为了进一步得到测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。

[0724] 在大白菜(白菜)叶片的叶面上喷洒具有所需浓度的活性成分制剂,干燥后,放入芥菜甲虫(辣根猿叶甲)的幼虫。

[0725] 7 天后,测定以%计的功效。100%意指所有甲虫幼虫都被杀死,0%意指没有甲虫幼虫被杀死。

[0726] 在本测试中,例如,来自制备实施例的的下列化合物在施用率为 500g/h 下显示出 100%的功效:I-2、I-3、I-4、I-5、I-10、I-12、I-13、I-14、I-18、I-19、I-21、I-22、I-24、I-25、I-26、I-28、I-29、I-31、I-36、I-37、I-38、I-39、I-41、I-42、I-43、I-44、I-45、I-46、I-47、I-48、I-49、I-50、I-51、I-52、I-53、I-54、I-55、I-61、I-68、I-73。

[0727] 在本测试中,例如,来自制备实施例的的下列化合物在施用率为 500g/h 下显示出 83%的功效:I-30、I-63。

[0728] 在本测试中,例如,来自制备实施例的的下列化合物在施用率为 100g/h 下显示出 100%的功效:I-11。

[0729] 在本测试中,例如,来自制备实施例的的下列化合物在施用率为 100g/h 下显示出 83%的功效:I-17。

[0730] 草地贪夜蛾-喷雾测试(SPODFR)

[0731] 溶剂:78 重量份的丙酮

[0732] 1.5 重量份的二甲基甲酰胺

[0733] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0734] 为了制备合适的活性成分制剂,使用上述重量份的溶剂来溶解 1 重量份的活性成分,用含有浓度为 1000ppm 乳化剂的水调节至得到所需浓度。为了进一步得到测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。

[0735] 在玉米(玉蜀黍(Zea mays))叶片上喷洒具有所需浓度的活性成分制剂,干燥后,放入粘虫(草地贪夜蛾)的毛虫。

[0736] 7 天后,测定以%计的功效。100%意指所有毛虫都被杀死,0%意指没有毛虫被杀死。

[0737] 在本测试中,例如,来自制备实施例的下列化合物在施用率为 500g/ha 下显示出 100%的功效:I-2、I-21、I-26、I-37、I-39、I-42、I-46、I-47、I-54、I-61、I-63、I-68。

[0738] 在本测试中,例如,来自制备实施例的下列化合物在施用率为 500g/ha 下显示出 83%的功效:I-14、I-19、I-48。

[0739] 二斑叶螨-喷雾测试、OP-抗性(TETRUR)

[0740] 溶剂:78.0 重量份的丙酮

[0741] 1.5 重量份的二甲基甲酰胺

[0742] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0743] 为了制备合适的活性成分制剂,使用上述重量份的溶剂来溶解 1 重量份的活性成分,用含有浓度为 1000ppm 乳化剂的水调节至得到所需浓度。为了进一步得到测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。

[0744] 在感染各阶段的温室红蜘蛛螨(二斑叶螨)的菜豆(Phaseolus vulgaris)叶片

上喷洒具有所需浓度的活性成分制剂。

[0745] 6 天后,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。

[0746] 在本测试中,例如,来自制备实施例的下列化合物在施用率为 500g/ha 下显示出 100%的功效:I-68。

[0747] 在本测试中,例如,来自制备实施例的下列化合物在施用率为 500g/ha 下显示出 90%的功效:I-2、I-13、I-19、I-22、I-28、I-42、I-44、I-53。

[0748] 在本测试中,例如,来自制备实施例的下列化合物在施用率为 100g/ha 下显示出 90%的功效:I-48。

[0749] 桃蚜 - 喷雾测试 (MYZUPE)

[0750] 溶剂:7 重量份的二甲基甲酰胺

[0751] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0752] 为了制备合适的活性成分制剂,使用上述重量份的溶剂来溶解 1 重量份的活性成分,用含有浓度为 1000ppm 乳化剂的水调节至得到所需浓度。为了进一步得到测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。如果需要添加铵盐或 / 和渗透剂,则其各自以 1000ppm 的浓度添加到制剂溶液中。

[0753] 对被绿桃蚜(桃蚜)严重感染的灯笼椒植株(甜椒(Capsicum annuum))通过喷洒具有所需浓度的活性成分制剂进行处理。

[0754] 6 天后,测定以%计的杀死情况。100%意指所有蚜虫都被杀死;0%意指没有蚜虫被杀死。

[0755] 在本测试中,例如,来自制备实施例的下列化合物在施用率为 100ppm 下显示出 97%的功效:I-11。

[0756] 根结线虫测试

[0757] 溶剂:125.0 重量份的丙酮

[0758] 为制备合适的活性成分制剂,将 1 重量份的活性成分与上述量的溶剂混合,并将浓缩物用水稀释至所需浓度。

[0759] 在容器内装入沙子、活性成分溶液、南方根结线虫(根结线虫)的卵/幼虫悬浮液和莴笋种子。莴笋种子发芽,并长成幼苗。虫瘿在根部发育。

[0760] 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%意指经处理的植株上虫瘿数量相当于未处理的对照组的数量。

[0761] 在本测试中,例如,来自制备实施例的下列化合物在施用率为 20ppm 下显示出 100%的功效:I-68。

[0762] 对照实施例:

[0763] 桃蚜 - 接触测试 (MYZUPE c)

[0764] 溶剂:7 重量份的二甲基甲酰胺

[0765] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0766] 为了制备合适的活性成分制剂,使用上述重量份的溶剂来溶解 1 重量份的活性成分,用含有浓度为 1000ppm 乳化剂的水调节至得到所需浓度。为了进一步得到测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。在需要添加铵盐或 / 和渗透剂(菜子油甲酯)的情况下,

在成品制剂溶液已被稀释后,其各自以 1000ppm 的浓度添加。

[0767] 对被绿桃蚜(桃蚜)严重感染的一片叶子的灯笼椒植株(甜椒(Capsicum annuum))通过对该叶的下面喷洒具有所需浓度的活性成分制剂进行处理。

[0768] 在所需时间后,测定以%计的杀死情况。100%意指所有蚜虫都已被杀死,0%意指没有蚜虫被杀死。

[0769] 在本测试中,例如,与来自 W02013018928 的已知化合物相比,来自制备实施例的下列化合物显示出良好的功效(见表)。

[0770] 桃蚜 - 转层(translaminar)测试(MYZUPE t)

[0771] 溶剂:7 重量份的二甲基甲酰胺

[0772] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0773] 为了制备合适的活性成分制剂,使用上述重量份的溶剂来溶解 1 重量份的活性成分,用含有浓度为 1000ppm 乳化剂的水调节至得到所需浓度。为了进一步得到测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。在需要添加铵盐或 / 和渗透剂(菜子油甲酯)的情况下,在成品制剂溶液已被稀释后,其各自以 1000ppm 的浓度添加。

[0774] 对被绿桃蚜(桃蚜)严重感染的一片叶子的灯笼椒植株(甜椒(Capsicum annuum))通过对该叶片的上部喷洒具有所需浓度的活性成分制剂进行处理。

[0775] 在所需时间后,测定以%计的杀死情况。100%意指所有蚜虫都已被杀死,0%意指没有蚜虫被杀死。

[0776] 在本测试中,例如,与来自 W02013018928 的已知化合物相比,来自制备实施例的下列化合物显示出良好的功效(见表)。

[0777] 棉蚜 - 接触测试(APHIGO c)

[0778] 溶剂:7 重量份的二甲基甲酰胺

[0779] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0780] 为了制备合适的活性成分制剂,使用上述重量份的溶剂来溶解 1 重量份的活性成分,用含有浓度为 1000ppm 乳化剂的水调节至得到所需浓度。为了进一步得到测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。在需要添加铵盐或 / 和渗透剂(菜子油甲酯)的情况下,在成品制剂溶液已被稀释后,其各自以 1000ppm 的浓度添加。

[0781] 对被棉蚜严重感染的一片叶子的棉花植株(陆地棉(Gossypium hirsutum))通过对该叶的下面喷洒具有所需浓度的活性成分制剂进行处理。

[0782] 在所需时间后,测定以%计的杀死情况。100%意指所有蚜虫都已被杀死,0%意指没有蚜虫被杀死。

[0783] 在本测试中,例如,与来自 W02013018928 的已知化合物相比,来自制备实施例的下列化合物显示出良好的功效(见表)。

[0784] 棉蚜 - 转层测试(APHIGO t)

[0785] 溶剂:7 重量份的二甲基甲酰胺

[0786] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0787] 为了制备合适的活性成分制剂,使用上述重量份的溶剂来溶解 1 重量份的活性成分,用含有浓度为 1000ppm 乳化剂的水调节至得到所需浓度。为了进一步得到测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。在需要添加铵盐或 / 和渗透剂(菜子油甲酯)的情况下,

在成品制剂溶液已被稀释后,其各自以 1000ppm 的浓度添加。

[0788] 对被棉蚜严重感染的一片叶子棉花植株(陆地棉(*Gossypium hirsutum*))通过对该叶片的上面喷洒具有所需浓度的活性成分制剂进行处理。

[0789] 在所需时间后,测定以%计的杀死情况。100%意指所有蚜虫都已被杀死,0%意指没有蚜虫被杀死。

[0790] 在本测试中,例如,与来自 W02013018928 的已知化合物相比,来自制备实施例的下列化合物显示出良好的功效(见表)。

[0791] 黑尾叶蝉测试 (NEPHCI)

[0792] 溶剂:7 重量份的二甲基甲酰胺

[0793] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0794] 为了制备合适的活性成分制剂,使用上述重量份的溶剂来溶解 1 重量份的活性成分,用含有浓度为 1000ppm 乳化剂的水调节至得到所需浓度。为了进一步得到测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。在需要添加铵盐或 / 和渗透剂(菜子油甲酯)的情况下,在成品制剂溶液已被稀释后,其各自以 1000ppm 的浓度添加。

[0795] 稻植株(*Oryza sativa*, Balilla 变种)通过喷洒具有所需浓度的活性成分制剂,然后放入稻黑尾叶蝉(*Nephotettix cincticeps*)的幼虫进行处理。

[0796] 在所需时间后,测定以%计的杀死情况。100%意指所有叶蝉都已被杀死;0%意指没有叶蝉被杀死。

[0797] 在本测试中,例如,与来自 W02013018928 的已知化合物相比,来自制备实施例的下列化合物显示出良好的功效(见表)。

[0798] 褐飞虱测试 (NILALU)

[0799] 溶剂:7 重量份的二甲基甲酰胺

[0800] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

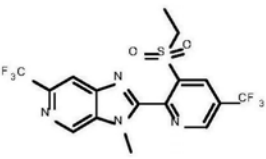
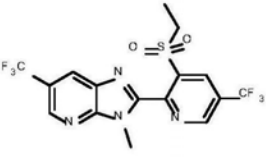
[0801] 为了制备合适的活性成分制剂,使用上述重量份的溶剂来溶解 1 重量份的活性成分,用含有浓度为 1000ppm 乳化剂的水调节至得到所需浓度。为了进一步得到测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。在需要添加铵盐或 / 和渗透剂(菜子油甲酯)的情况下,在成品制剂溶液已被稀释后,其各自以 1000ppm 的浓度添加。

[0802] 稻植株(*Oryza sativa*, Balilla 变种)通过喷洒具有所需浓度的活性成分制剂,然后放入稻褐飞虱的 L3 幼虫进行处理。

[0803] 在所需时间后,测定以%计的摄食损害。100%意指没有摄食损害发生;0%意指经处理的植株的摄食损害相当于未处理对照的摄食损害。

[0804] 在本测试中,例如,与来自 W02013018928 的已知化合物相比,来自制备实施例的下列化合物显示出良好的功效(见表)。

[0805]

物质	结构	动物物种	浓度	%功效天数*
实施例 I-21		MYZUPE c	2.4 g/ha	85 14 天
		MYZUPE t	12 g/ha	98 14 天
		MYZUPE t	2.4 g/ha	90 14 天
		APHIGO c	2.4 g/ha	98 7 天
		APHIGO t	2.4 g/ha	65 7 天
		NEPHCI	0.16 ppm	90 14 天
		NEPHCI	0.16 ppm	95 21 天
		NEPHCI	0.16 ppm	100 34 天
		NILALU	4 ppm	90 21 天
		NILALU	4 ppm	100 28 天
实施例 5 已知于 WO2013018928		MYZUPE c	2.4 g/ha	50 14 天
		MYZUPE t	12 g/ha	0 14 天
		MYZUPE t	2.4 g/ha	0 14 天
		APHIGO c	2.4 g/ha	15 7 天
		APHIGO t	2.4 g/ha	0 7 天
		NEPHCI	0.16 ppm	0 14 天
		NEPHCI	0.16 ppm	0 21 天
		NEPHCI	0.16 ppm	0 34 天
		NILALU	4 ppm	35 21 天
		NILALU	4 ppm	20 28 天

[0806] * 天=处理后的天数