



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 104039780 A

(43) 申请公布日 2014. 09. 10

(21) 申请号 201280067028. 6

(22) 申请日 2012. 11. 16

(30) 优先权数据

61/561, 324 2011. 11. 18 US

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2014. 07. 14

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/EP2012/072810 2012. 11. 16

(87) PCT国际申请的公布数据

W02013/072450 EN 2013. 05. 23

(71) 申请人 巴斯夫欧洲公司

地址 德国路德维希港

(72) 发明人 H·克罗斯 M·维切尔 T·塞茨

T·W·牛顿 L·帕尔拉帕多

R·阿朋特 K·克罗伊茨

K·格罗斯曼 J·莱尔希尔

R·R·埃万斯

(74) 专利代理机构 北京市中咨律师事务所

11247

代理人 王丹丹 刘金辉

(51) Int. Cl.

C07D 413/12 (2006. 01)

C07D 471/04 (2006. 01)

A01N 43/82 (2006. 01)

权利要求书8页 说明书97页

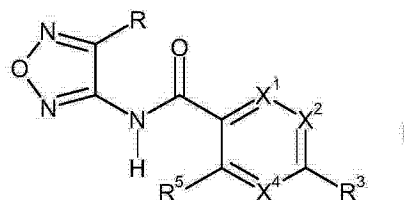
(54) 发明名称

取代的 1, 2, 5- 噁二唑化合物及其作为除草剂的用途 III

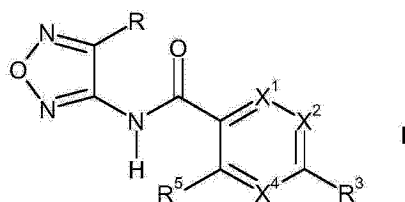
(57) 摘要

本发明涉及式 I 的取代的 1, 2, 5- 噁二唑化合物及其 N- 氧化物和盐, 以及包含它们的组合物。本发明还涉及 1, 2, 5- 噁二唑化合物或包含该类化合物的组合物在防治不希望的植物生长中的用途。在式 I 中, X^1 为 N 或 CR^1 ; X^2 为 N 或 CR^2 ; X^4 为 N 或 CR^4 ; 条件是 X^1 、 X^2 和 X^4 中至少一个为 N; R 例如选自氢、氰基、硝基、卤素、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_7 环烷基、 C_3 - C_7 环烷基- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 卤代炔基、 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、 $O-R^a$ 、 $Z-S(O)_n-R^b$ 、 $Z-C(=O)-R^c$ 、 $Z-C(=O)-OR^d$ 、 $Z-C(=O)-NR^eR^f$ 、 $Z-NR^gR^h$ 、Z- 苯基和 Z- 杂环基; R^1 例如选自 Z^1 - 氰基、卤素、硝基、 C_1 - C_8 烷基、 C_2 - C_8 链烯基、 C_2 - C_8 炔基、 C_1 - C_8 卤代烷基、 C_1 - C_8 烷氧基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基、 Z^1 - C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷硫基- C_1 - C_4 烷基、 Z^1 - C_1 - C_4 烷硫基- C_1 - C_4 烷硫基、 C_2 - C_6 链烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基- C_1 - C_4 烷基、 Z^1 - C_1 - C_4 卤代烷氧基- C_1 - C_4 烷氧基、 Z^1 -S(O)_k- R^{1b} 、 Z^1 - 苯氧基和 Z^1 - 杂环氧基; R^2 、 R^3 相同或不同且例如选自氢、

卤素、 Z^2 -OH、 Z^2 -NO₂、 Z^2 - 氰基、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_8 链烯基、 C_2 - C_8 炔基、 Z^2 - C_3 - C_{10} 环烷基、 Z^2 - C_3 - C_{10} 环烷氧基、 C_1 - C_8 卤代烷基、 Z^2 - C_1 - C_8 烷氧基、 Z^2 - C_1 - C_8 卤代烷氧基、 Z^2 - C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷氧基、 Z^2 - C_1 - C_4 烷硫基- C_1 - C_4 烷硫基等, R^4 选自氢、卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 卤代烷基; R^5 选自氢、卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 卤代烷基。



1. 一种式 I 的 1,2,5-噁二唑化合物、其 N-氧化物或可农用盐：



其中

X^1 为 N 或 CR^1 ；

X^2 为 N 或 CR^2 ；

X^4 为 N 或 CR^4 ；

条件是 X^1 、 X^2 和 X^4 中至少一个为 N；

R 选自氢、氰基、硝基、卤素、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_7 环烷基、 C_3 - C_7 环烷基- C_1 - C_4 烷基，其中上述两个基团中的 C_3 - C_7 环烷基未被取代或者部分或完全被卤代， C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 卤代炔基、 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、 $O-R^a$ 、 $Z-S(O)_n-R^b$ 、 $Z-C(=O)-R^c$ 、 $Z-C(=O)-OR^d$ 、 $Z-C(=O)-NR^eR^f$ 、 $Z-NR^gR^h$ 、Z-苯基和 Z-杂环基，其中杂环基为含有 1、2、3 或 4 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的 3、4、5 或 6 员单环或 8、9 或 10 员双环饱和、部分不饱和或芳族杂环，其中苯基和杂环基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同的基团 R' 取代；

R^1 选自 Z^1 -氰基、卤素、硝基、 C_1 - C_8 烷基、 C_2 - C_8 链烯基、 C_2 - C_8 炔基、 C_1 - C_8 卤代烷基、 C_1 - C_8 烷氧基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基、 Z^1 - C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基- C_1 - C_4 烷基、 Z^1 - C_1 - C_4 烷硫基- C_1 - C_4 烷硫基、 C_2 - C_6 链烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基- C_1 - C_4 烷基、 Z^1 - C_1 - C_4 卤代烷氧基- C_1 - C_4 烷氧基、 $Z^1-S(O)_k-R^{1b}$ 、 Z^1 -苯氧基和 Z^1 -杂环氧基，其中杂环氧基为含有 1、2、3 或 4 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的氧键合 3、4、5 或 6 员单环或 8、9 或 10 员双环饱和、部分不饱和或芳族杂环，其中苯氧基和杂环氧基中的环状基团未被取代或被 1、2、3 或 4 个相同或不同基团 R^{11} 取代；

R^2 、 R^3 相同或不同且独立地选自氢、卤素、 Z^2-OH 、 Z^2-NO_2 、 Z^2 -氰基、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_8 链烯基、 C_2 - C_8 炔基、 Z^2 - C_3 - C_{10} 环烷基、 Z^2 - C_3 - C_{10} 环烷氧基，其中上述两个基团中的 C_3 - C_{10} 环烷基未被取代或者部分或完全被卤代， C_1 - C_8 卤代烷基、 Z^2 - C_1 - C_8 烷氧基、 Z^2 - C_1 - C_8 卤代烷氧基、 Z^2 - C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷氧基、 Z^2 - C_1 - C_4 烷硫基- C_1 - C_4 烷硫基、 Z^2 - C_2 - C_8 链烯氧基、 Z^2 - C_2 - C_8 炔氧基、 Z^2 - C_1 - C_8 卤代烷氧基、 Z^2 - C_1 - C_4 卤代烷氧基- C_1 - C_4 烷氧基、 $Z^2-(三-C_1-C_4 烷基) 甲硅烷基$ 、 $Z^2-S(O)_k-R^{2b}$ 、 $Z^2-C(=O)-R^{2c}$ 、 $Z^2-C(=O)-OR^{2d}$ 、 $Z^2-C(=O)-NR^{2e}R^{2f}$ 、 $Z^2-NR^{2g}R^{2h}$ 、 Z^{2a} -苯基和 Z^{2a} -杂环基，其中杂环基为含有 1、2、3 或 4 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的 3、4、5 或 6 员单环或 8、9 或 10 员双环饱和、部分不饱和或芳族杂环，其中 Z^{2a} -苯基和 Z^{2a} -杂环基中的环状基团未被取代或被 1、2、3 或 4 个相同或不同的基团 R^{21} 取代；

R^4 选自氢、卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 卤代烷基；

R^5 选自氢、卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 卤代烷基；

其中对于 $X^2 = CR^2$ ， R^2 与 R^3 一起或者若存在的话与 R^1 一起还可以形成稠合 5、6、7、8、9 或 10 员碳环或稠合 5、6、7、8、9 或 10 员杂环，其中稠合杂环具有 1、2、3 或 4 个选自 O、S 和 N 的杂原子作为环成员，其中稠合碳环和稠合杂环是单环或双环的且其中稠合碳环和稠合

杂环未被取代或者带有 1、2、3、4、5、6、7、8、9 或 10 个基团 R^a ；

n 为 0、1 或 2；

k 为 0、1 或 2；

R' 、 R^{11} 、 R^{21} 相互独立地选自卤素、 NO_2 、 CN 、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 环烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 卤代环烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 卤代烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 链烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 卤代链烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 炔基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 卤代炔基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 卤代烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷硫基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基和 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 环烷氧基，或者两个邻位基团 R' 、 R^{11} 或 R^{21} 一起可以形成基团 = O (氧代)；

Z、 Z^1 、 Z^2 相互独立地选自共价键和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 链烷二基；

Z^{2a} 选自共价键、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 链烷二基、 $\text{O-C}_1\text{-C}_4$ 链烷二基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 链烷二基 -O 和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 链烷二基 -O- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 链烷二基；

R^a 选自氢、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 环烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 环烷基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基，其中上述两个基团中的 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 环烷基未被取代或者部分或完全被卤代， $\text{C}_1\text{-C}_6$ 卤代烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 链烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 卤代链烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 炔基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 卤代炔基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、苯基和苄基，其中苯基和苄基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷氧基的基团取代；

R^b 、 R^{1b} 、 R^{2b} 相互独立地选自 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 环烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 卤代烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 链烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 卤代链烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 炔基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 卤代炔基、苯基和杂环基，其中杂环基为含有 1、2、3 或 4 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的 5 或 6 员单环饱和、部分不饱和或芳族杂环，其中苯基和杂环基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷氧基的基团取代；

R^c 、 R^{2c} 相互独立地选自氢、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 环烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 环烷基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基，其中上述两个基团中的 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 环烷基未被取代或者部分或完全被卤代， $\text{C}_1\text{-C}_6$ 卤代烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 链烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 卤代链烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 炔基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 卤代炔基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、苯基、苄基或杂环基，其中杂环基为含有 1、2、3 或 4 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的 5 或 6 员单环饱和、部分不饱和或芳族杂环，其中苯基、苄基和杂环基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷氧基的基团取代；

R^d 、 R^{2d} 相互独立地选自 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 环烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 环烷基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基，其中上述两个基团中的 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 环烷基未被取代或者部分或完全被卤代， $\text{C}_1\text{-C}_6$ 卤代烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 链烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 卤代链烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 炔基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 卤代炔基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、苯基和苄基，其中苯基和苄基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷氧基的基团取代；

R^e 、 R^f 相互独立地选自氢、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 环烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 环烷基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基，其中上述两个基团中的 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 环烷基未被取代或者部分或完全被卤代， $\text{C}_1\text{-C}_6$ 卤代烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 链烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 卤代链烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 炔基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 卤代炔基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、苯基和苄基，其中苯基和苄基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷氧基的基团取代，或者

R^e 、 R^f 与它们所键合的氮原子一起可以形成 5、6 或 7 员饱和或不饱和 N-键合杂环基团，

所述杂环基团可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员且未被取代或者可以带有 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的基团；

R^{2e} 、 R^{2f} 相互独立地具有对 R^e 、 R^f 所给含义；

R^g 选自氢、 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_7 环烷基、 C_3-C_7 环烷基- C_1-C_4 烷基，其中上述两个基团中的 C_3-C_7 环烷基未被取代或者部分或完全被卤代， C_1-C_6 卤代烷基、 C_2-C_6 链烯基、 C_2-C_6 卤代链烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_2-C_6 卤代炔基、 C_1-C_4 烷氧基- C_1-C_4 烷基、苯基和苄基，其中苯基和苄基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的基团取代；

R^h 选自氢、 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_7 环烷基、 C_3-C_7 环烷基- C_1-C_4 烷基，其中上述两个基团中的 C_3-C_7 环烷基未被取代或者部分或完全被卤代， C_1-C_6 卤代烷基、 C_2-C_6 链烯基、 C_2-C_6 卤代链烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_2-C_6 卤代炔基、 C_1-C_4 烷氧基- C_1-C_4 烷基、基团 $C(=O)-R^k$ 、苯基和苄基，其中苯基和苄基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的基团取代；或者

R^g 、 R^h 与它们所键合的氮原子一起可以形成 5、6 或 7 员饱和或不饱和 N-键合杂环基团，所述杂环基团可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员且未被取代或者可以带有 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自 $=O$ 、卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的基团；

R^{2g} 、 R^{2h} 相互独立地具有对 R^g 、 R^h 所给含义；

R^k 具有对 R^c 所给含义；

R^q 选自卤素、 Z^q-OH 、 Z^q-NO_2 、 Z^q -氰基、氧代 ($=O$)、 $N-R^{q1}$ 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 炔基、 $Z^q-C_1-C_4$ 烷氧基、 $Z^q-C_1-C_4$ 烷氧基- C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 卤代烷硫基、 $Z^q-C_1-C_4$ 卤代烷氧基、 $Z^q-C_3-C_{10}$ 环烷基、 $O-Z^q-C_3-C_{10}$ 环烷基、 $Z^q-(三-C_1-C_4$ 烷基)甲硅烷基、 $Z^q-S(O)_k-R^{q2}$ 、 $Z^2-C(=O)-R^{q3}$ 、 $Z^2-NR^{q4}R^{q5}$ 和 Z^q -苯基，其中 Z^q -苯基中的苯基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同的基团 R^{q6} 取代；其中

Z^q 具有对 Z 所给含义之一；

R^{q1} 为 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基和 C_3-C_7 环烷氧基，其未被取代或者部分或完全被卤代；

R^{q2} 具有对 R^b 所给含义之一；

R^{q3} 具有对 R^c 所给含义之一；

R^{q4} 、 R^{q5} 相互独立地具有对 R^g 、 R^h 所给含义之一；

R^{q6} 具有对 R' 所给含义之一。

2. 如权利要求 1 所要求的化合物，其中 R 选自卤素、氰基、硝基、 NH_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基- C_1-C_4 烷基、 C_3-C_7 环烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 $C(=O)-R^c$ 、 $C(=O)-OR^d$ 、 $C(=O)-NR^eR^f$ 和 $NH-C(=O)R^k$ ，其中

R^c 为 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 卤代烷基，

R^d 为 C_1-C_4 烷基，

R^e 为氢或 C_1-C_4 烷基，

R^f 为氢或 C_1-C_4 烷基，或者

R^e 、 R^f 与它们所键合的氮原子一起可以形成可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员且未被取代或者可以带有 1、2、3 或 4 个甲基的 5、6 或 7 员饱和 N- 键合杂环基团，

R^k 为 C_1 - C_4 烷基。

3. 如权利要求 1 所要求的化合物，其中 R 为基团 OR^a ，其中 R^a 选自 H、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷基和 C_3 - C_7 环烷基，其未被取代或者部分或完全被卤代。

4. 如权利要求 1 所要求的化合物，其中 R 为苯基或杂环基，其中杂环基为含有 1、2、3 或 4 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的 5 或 6 员单环或 8、9 或 10 员双环饱和、部分不饱和或芳族杂环，其中苯基和杂环基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个基团 R' 取代，其中 R' 选自卤素、甲基、乙基、甲氧基和三氟甲基。

5. 如权利要求 1 所要求的化合物，其中 R 为 $S(O)_n-R^b$ ，其中 R^b 为 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_7 环烷基、苯基和杂环基，其中杂环基为具有 1 或 2 个氮原子作为环成员的 6 员芳族杂环基团。

6. 如前述权利要求中任一项所要求的化合物，其中 R^3 选自氢、氰基、卤素、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_2 - C_4 链烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_2 - C_4 链烯氧基、 C_2 - C_4 炔氧基和 $S(O)_kR^{2b}$ 。

7. 如前述权利要求中任一项所要求的化合物，其中 R^3 选自氢、卤素、CN、 NO_2 、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 卤代烷硫基、 $S(O)_2$ - C_1 - C_4 烷基和 $S(O)_2$ - C_1 - C_4 卤代烷基。

8. 如前述权利要求中任一项所要求的化合物，其中 R^5 选自氢、 CHF_2 、 CF_3 、CN、 NO_2 、 CH_3 和卤素。

9. 如前述权利要求中任一项所要求的化合物，其中 X^1 为 CR^1 。

10. 如权利要求 9 所要求的化合物，其中 R^1 选自氰基、卤素、硝基、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 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、 Z^1 - C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基 - C_1 - C_4 烷基、 Z^1 - C_1 - C_4 烷硫基 - C_1 - C_4 烷硫基、 C_2 - C_6 链烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基 - C_1 - C_4 烷氧基和 $S(O)_kR^{1b}$ ，其中 k 和 Z^1 如权利要求 1 所定义且其中 R^{1b} 选自 C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 卤代烷基。

11. 如权利要求 9 或 10 所要求的化合物，其中 R^1 选自卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 卤代烷硫基、 C_1 - C_4 烷基磺酰基、 C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷基。

12. 如权利要求 9-11 中任一项所要求的化合物，其中

R^1 选自卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 卤代烷硫基和 C_1 - C_4 烷基磺酰基；以及

R^3 选自氢、卤素、CN、 NO_2 、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷硫基和 C_1 - C_4 烷基磺酰基。

13. 如权利要求 1-8 中任一项所要求的化合物，其中 X^1 为 N。

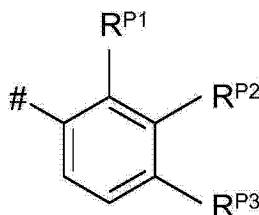
14. 如权利要求 1-12 中任一项所要求的化合物，其中 X^2 为 CR^2 。

15. 如权利要求 14 所要求的化合物,其中 R^2 不为氢。

16. 如权利要求 14 或 15 所要求的化合物,其中 R^2 为 5 或 6 员杂环基,其中杂环基为含有 1 个选自 O、N 和 S 的杂原子以及 0、1 或 2 个另外的氮原子作为环成员的饱和、部分不饱和或芳族杂环基团,其中杂环基未被取代或者带有 1、2 或 3 个相同或不同的基团 R^{21} 。

17. 如权利要求 14 或 15 所要求的化合物,其中 R^2 为选自异噻唑啉基、1,2-二氢四唑啉酮基、1,4-二氢四唑啉酮基、四氢呋喃基、二氧戊环基、哌啶基、吗啉基、哌嗪基、异噻唑基、吡唑基、噻唑基、噁唑基、呋喃基、吡啶基和吡嗪基的 5 或 6 员杂环基,其中杂环基未被取代或者带有 1、2 或 3 个相同或不同且选自卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷氧基- C_1-C_4 烷基和 C_1-C_4 烷硫基- C_1-C_4 烷基的基团 R^{21} 。

18. 如权利要求 14 或 15 所要求的化合物,其中 R^2 为下式的基团:



其中 # 表示基团 R^2 通过其连接的键,以及

R^{P1} 为 H 或 F;

R^{P2} 为 H、F、Cl 或 OCH_3 ; 以及

R^{P3} 为 H、F、Cl、 CH_3 、 CF_3 、 OCH_3 、 OCH_2OCH_3 或 $OCH_2CH_2OCH_3$ 。

19. 如权利要求 14 或 15 所要求的化合物,其中 R^2 选自卤素、 C_1-C_6 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_6 链烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_2-C_4 烷氧基、 C_2-C_4 卤代烷氧基、 C_3-C_6 链烯氧基、 C_3-C_6 炔氧基、 C_1-C_4 烷氧羰基、 $S(O)_2-C_1-C_4$ 烷基和 $S(O)_2-C_1-C_4$ 卤代烷基。

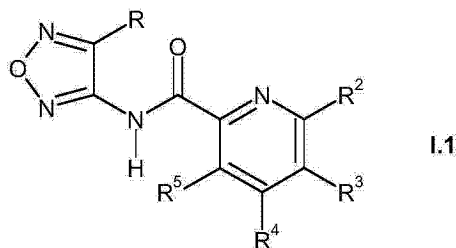
20. 如权利要求 14 所要求的化合物,其中 R^2 与 R^3 一起或者若存在的话与 R^1 一起形成稠合 5、6、7、8、9 或 10 员碳环或稠合 5、6、7、8、9 或 10 员杂环,其中稠合杂环具有 1、2、3 或 4 个选自 O、S 和 N 的杂原子作为环成员,其中稠合碳环和稠合杂环是单环或双环的且其中稠合碳环和稠合杂环未被取代或者带有 1、2、3、4、5、6、7、8、9 或 10 个基团 R^q 。

21. 如前述权利要求中任一项所要求的化合物,其中 X^2 为 N。

22. 如前述权利要求中任一项所要求的化合物,其中 X^4 为 CR^4 。

23. 如前述权利要求中任一项所要求的化合物,其中 R^4 选自氢、 CHF_2 、 CF_3 、CN、 NO_2 、 CH_3 和卤素。

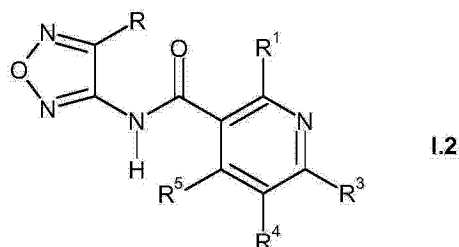
24. 如前述权利要求中任一项所要求的化合物,其中式 I 由式 I.1 表示:



其中 R 、 R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^5 如权利要求 1-8、14-20、22 和 23 中任一项所定义。

25. 如权利要求 24 所要求的化合物, 其中 R^2 选自氢、 C_1 - C_2 烷氧基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷氧基、 C_1 - C_2 烷基、 $S(O)_2$ - C_1 - C_4 烷基、异噁唑基和异噁唑啉基, 其中后提到的 2 个基团可以被取代或者带有 1 或 2 个选自卤素和 C_1 - C_4 烷基的基团。

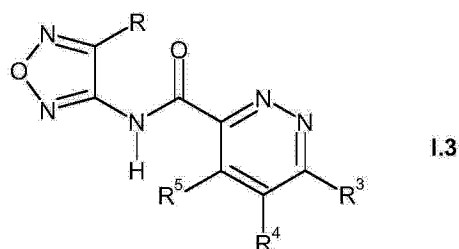
26. 如权利要求 1-23 中任一项所要求的化合物, 其中式 I 由式 I.2 表示:



其中 R 、 R^1 、 R^3 、 R^4 和 R^5 如权利要求 1-12、22 和 23 中任一项所定义。

27. 如权利要求 26 所要求的化合物, 其中 R^1 为卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 卤代烷硫基或 C_1 - C_4 烷基磺酰基。

28. 如权利要求 1-23 中任一项所要求的化合物, 其中式 I 由式 I.3 表示:



其中 R 、 R^3 、 R^4 和 R^5 如权利要求 1-8 和 22-23 中任一项所定义。

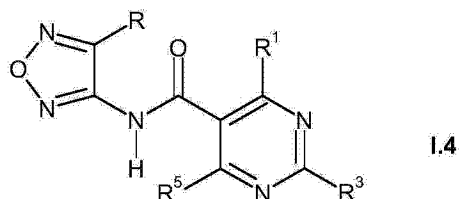
29. 如权利要求 24-28 中任一项所要求的化合物, 其中

R^3 选自氢、卤素、 CN 、 NO_2 、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷硫基和 C_1 - C_4 烷基磺酰基;

R^4 选自氢、 CN 、 CHF_2 、 CF_3 、 CH_3 、 NO_2 和卤素; 以及

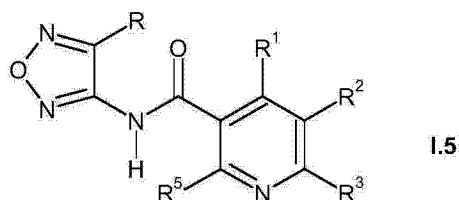
R^5 选自氢、卤素、 CH_3 、 CHF_2 和 CF_3 。

30. 如权利要求 1-23 中任一项所要求的化合物, 其中式 I 由式 I.4 表示:



其中 R 、 R^1 、 R^3 和 R^5 如权利要求 1-12 中任一项所定义。

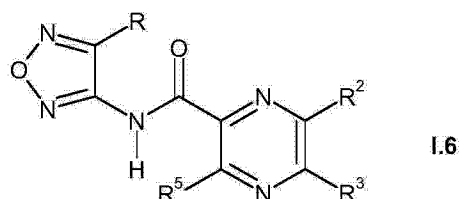
31. 如权利要求 1-23 中任一项所要求的化合物, 其中式 I 由式 I.5 表示:



其中 R、R¹、R²、R³ 和 R⁵ 如权利要求 1-12 和 14-20 中任一项所定义。

32. 如权利要求 30 或 31 所要求的化合物,其中 R¹ 为卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₄ 卤代烷硫基或 C₁-C₄ 烷基磺酰基。

33. 如权利要求 1-23 中任一项所要求的化合物,其中式 I 由式 I.6 表示:

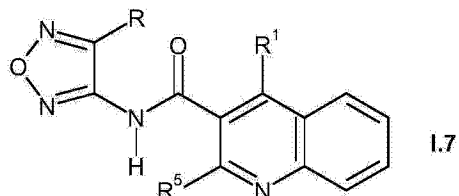


其中 R、R²、R³ 和 R⁵ 如权利要求 1-8 和 14-20 中任一项所定义。

34. 如权利要求 33 所要求的化合物,其中 R² 选自氢、C₁-C₂ 烷氧基 -C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 卤代烷氧基 -C₁-C₂ 烷基、S(O)₂-C₁-C₄ 烷基、异噁唑基和异噁唑啉基,其中后提到的 2 个基团可以被取代或者带有 1 或 2 个选自卤素和 C₁-C₄ 烷基的基团。

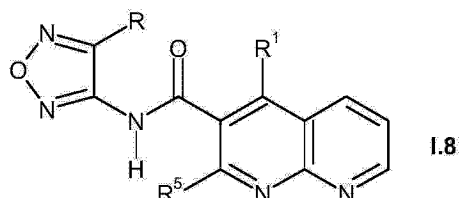
35. 如权利要求 33 或 34 所要求的化合物,其中 R³ 选自氢、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷硫基和 C₁-C₄ 烷基磺酰基;以及 R⁵ 选自氢、卤素、CH₃、CHF₂ 和 CF₃。

36. 如权利要求 1-23 中任一项所要求的化合物,其中式 I 由式 I.7 表示:



其中 R、R¹ 和 R⁵ 如权利要求 1-5 和 8-11 中任一项所定义。

37. 如权利要求 1-23 中任一项所要求的化合物,其中式 I 由式 I.8 表示:



其中 R、R¹ 和 R⁵ 如权利要求 1-5 和 8-11 中任一项所定义。

38. 如权利要求 36 或 37 所要求的化合物,其中 R¹ 为卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₄ 卤代烷硫基或 C₁-C₄ 烷基磺酰基。

39. 如权利要求 36-38 中任一项所要求的化合物,其中 R⁵ 选自氢、卤素、CHF₂ 和 CF₃。

40. 如权利要求 24-39 中任一项所要求的化合物,其中 R 选自 C₁-C₄ 烷基和 C₁-C₄ 烷氧基。

41. 一种包含至少一种如权利要求 1-40 中任一项所要求的化合物和至少一种常用于配制作物保护化合物的助剂的组合物。

42. 如权利要求 1-40 中任一项所要求的化合物或权利要求 41 的组合物在防治不希望的植物生长中的用途。

43. 一种防治不希望的植物生长的方法,包括使除草有效量的至少一种如权利要求 1-40 中任一项所要求的化合物或权利要求 41 的组合物作用于植物、其种子和 / 或其生长地。

取代的 1, 2, 5- 噁二唑化合物及其作为除草剂的用途 III

[0001] 本发明涉及取代的 1, 2, 5- 噁二唑化合物及其 N- 氧化物和盐以及包含它们的组合物。本发明还涉及 1, 2, 5- 噁二唑化合物或包含该类化合物的组合物在防治不希望的植物生长中的用途。此外, 本发明涉及施用该类化合物的方法。

[0002] 为了防治不希望的植物生长, 尤其是在作物中防治不希望的植物生长的目的, 持续需要具有高活性和选择性以及对人类和动物基本没有毒性的新除草剂。

[0003] EP0 173 657A1 和 W02011/035874 描述了除草活性的 N-(1, 2, 5- 噁二唑 -3- 基) 羧酰胺。

[0004] 现有技术的 N-(1, 2, 5- 噁二唑 -3- 基) 羧酰胺通常尤其在低施用率下除草活性不足和 / 或选择性并不令人满意, 这导致与农作物的低相容性。

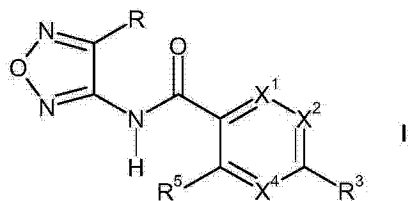
[0005] 因此, 本发明的目的是要提供具有强除草活性, 尤其是甚至在低施用率下具有强除草活性, 对人类和动物的毒性足够低和 / 或与农作物具有高相容性的其他 1, 2, 5- 噁二唑化合物。这些 1, 2, 5- 噁二唑化合物还应对大量不同的不希望植物显示出宽活性谱。

[0006] 这些和其他目的由如下所定义的式 I 化合物及其 N- 氧化物以及还有其可农用盐实现。

[0007] 已经发现上述目的可以通过如下所定义通式 I 的取代的 1, 2, 5- 噁二唑化合物实现, 这包括其 N- 氧化物及其盐, 尤其是其可农用盐。

[0008] 因此, 在第一方面, 本发明涉及式 I 化合物或其 N- 氧化物或可农用盐:

[0009]



[0010] 其中

[0011] X^1 为 N 或 CR^1 ;

[0012] X^2 为 N 或 CR^2 ;

[0013] X^4 为 N 或 CR^4 ;

[0014] 条件是 X^1 、 X^2 和 X^4 中至少一个为 N;

[0015] R 选自氢、氰基、硝基、卤素、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_7 环烷基、 C_3 - C_7 环烷基- C_1 - C_4 烷基, 其中上述两个基团中的 C_3 - C_7 环烷基未被取代或者部分或完全被卤代, C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 卤代炔基、 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、 $O-R^a$ 、 $Z-S(O)_n-R^b$ 、 $Z-C(=O)-R^c$ 、 $Z-C(=O)-OR^d$ 、 $Z-C(=O)-NR^eR^f$ 、 $Z-NR^gR^h$ 、 Z - 苯基和 Z - 杂环基, 其中杂环基为含有 1、2、3 或 4 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为

环成员的 3、4、5 或 6 员单环或 8、9 或 10 员双环饱和、部分不饱和或芳族杂环,其中苯基和杂环基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同的基团 R' 取代;

[0016] R^1 选自 Z^1 -氰基、卤素、硝基、 C_1 - C_8 烷基、 C_2 - C_8 链烯基、 C_2 - C_8 炔基、 C_1 - C_8 卤代烷基、 C_1 - C_8 烷氧基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基、 Z^1 - C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基- C_1 - C_4 烷基、 Z^1 - C_1 - C_4 烷硫基- C_1 - C_4 烷硫基、 C_2 - C_6 链烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基- C_1 - C_4 烷基、 Z^1 - C_1 - C_4 卤代烷氧基- C_1 - C_4 烷氧基、 Z^1 -S(O)_k- R^{1b} 、 Z^1 -苯氧基和 Z^1 -杂环氧基,其中杂环氧基为含有 1、2、3 或 4 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的氧键合 3、4、5 或 6 员单环或 8、9 或 10 员双环饱和、部分不饱和或芳族杂环,其中苯氧基和杂环氧基中的环状基团未被取代或被 1、2、3 或 4 个相同或不同基团 R^{11} 取代;

[0017] R^2 、 R^3 相同或不同且独立地选自氢、卤素、 Z^2 -OH、 Z^2 -NO₂、 Z^2 -氰基、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_8 链烯基、 C_2 - C_8 炔基、 Z^2 - C_3 - C_{10} 环烷基、 Z^2 - C_3 - C_{10} 环烷氧基,其中上述两个基团中的 C_3 - C_{10} 环烷基未被取代或者部分或完全被卤代, C_1 - C_8 卤代烷基、 Z^2 - C_1 - C_8 烷氧基、 Z^2 - C_1 - C_8 卤代烷氧基、 Z^2 - C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷氧基、 Z^2 - C_1 - C_4 烷硫基- C_1 - C_4 烷硫基、 Z^2 - C_2 - C_8 链烯氧基、 Z^2 - C_2 - C_8 炔氧基、 Z^2 - C_1 - C_8 卤代烷氧基、 Z^2 - C_1 - C_4 卤代烷氧基- C_1 - C_4 烷氧基、 Z^2 -(三- C_1 - C_4 烷基)甲硅烷基、 Z^2 -S(O)_k- R^{2b} 、 Z^2 -C(=O)- R^{2c} 、 Z^2 -C(=O)-OR^{2d}、 Z^2 -C(=O)-NR^{2e}R^{2f}、 Z^2 -NR^{2g}R^{2h}、 Z^{2a} -苯基和 Z^{2a} -杂环基,其中杂环基为含有 1、2、3 或 4 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的 3、4、5 或 6 员单环或 8、9 或 10 员双环饱和、部分不饱和或芳族杂环,其中 Z^{2a} -苯基和 Z^{2a} -杂环基中的环状基团未被取代或被 1、2、3 或 4 个相同或不同的基团 R^{21} 取代;

[0018] R^4 选自氢、卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 卤代烷基;

[0019] R^5 选自氢、卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 卤代烷基;

[0020] 其中对于 $X^2 = CR^2$, R^2 与 R^3 一起或者若存在的话与 R^1 一起还可以形成稠合 5、6、7、8、9 或 10 员碳环或稠合 5、6、7、8、9 或 10 员杂环,其中稠合杂环具有 1、2、3 或 4 个选自 O、S 和 N 的杂原子作为环成员,其中稠合碳环和稠合杂环是单环或双环的且其中稠合碳环和稠合杂环未被取代或者带有 1、2、3、4、5、6、7、8、9 或 10 个基团 R^a ;

[0021] n 为 0、1 或 2;

[0022] k 为 0、1 或 2;

[0023] R' 、 R^{11} 、 R^{21} 相互独立地选自卤素、NO₂、CN、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_7 环烷基、 C_3 - C_7 卤代环烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 卤代炔基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷硫基- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷氧基和 C_3 - C_7 环烷氧基,或者两个邻位基团 R' 、 R^{11} 或 R^{21} 一起可以形成基团 = O(氧代);

[0024] Z、 Z^1 、 Z^2 相互独立地选自共价键和 C_1 - C_4 链烷二基;

[0025] Z^{2a} 选自共价键、 C_1 - C_4 链烷二基、O- C_1 - C_4 链烷二基、 C_1 - C_4 链烷二基-O 和 C_1 - C_4 链烷二基-O- C_1 - C_4 链烷二基;

[0026] R^a 选自氢、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_7 环烷基、 C_3 - C_7 环烷基- C_1 - C_4 烷基,其中上述两个基团中的 C_3 - C_7 环烷基未被取代或者部分或完全被卤代, C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 卤代炔基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基、苯基和苄基,其中苯基和苄基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基和 C_1 - C_4 卤代烷氧基的基团取代;

[0027] R^b 、 R^{1b} 、 R^{2b} 相互独立地选自 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_7 环烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 卤代炔基、苯基和杂环基,其中杂环基为含有 1、2、3 或 4 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的 5 或 6 员单环饱和、部分不饱和或芳族杂环,其中苯基和杂环基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基和 C_1 - C_4 卤代烷氧基的基团取代;

[0028] R^c 、 R^{2c} 相互独立地选自氢、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_7 环烷基、 C_3 - C_7 环烷基 - C_1 - C_4 烷基,其中上述两个基团中的 C_3 - C_7 环烷基未被取代或者部分或完全被卤代, C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 卤代炔基、 C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷基、苯基、苄基或杂环基,其中杂环基为含有 1、2、3 或 4 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的 5 或 6 员单环饱和、部分不饱和或芳族杂环,其中苯基、苄基和杂环基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基和 C_1 - C_4 卤代烷氧基的基团取代;

[0029] R^d 、 R^{2d} 相互独立地选自 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_7 环烷基、 C_3 - C_7 环烷基 - C_1 - C_4 烷基,其中上述两个基团中的 C_3 - C_7 环烷基未被取代或者部分或完全被卤代, C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 卤代炔基、 C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷基、苯基和苄基,其中苯基和苄基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基和 C_1 - C_4 卤代烷氧基的基团取代;

[0030] R^e 、 R^f 相互独立地选自氢、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_7 环烷基、 C_3 - C_7 环烷基 - C_1 - C_4 烷基,其中上述两个基团中的 C_3 - C_7 环烷基未被取代或者部分或完全被卤代, C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 卤代炔基、 C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷基、苯基和苄基,其中苯基和苄基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基和 C_1 - C_4 卤代烷氧基的基团取代,或者

[0031] R^e 、 R^f 与它们所键合的氮原子一起可以形成 5、6 或 7 员饱和或不饱和 N- 键合杂环基团,该杂环基团可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员且未被取代或者可以带有 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基和 C_1 - C_4 卤代烷氧基的基团;

[0032] R^{2e} 、 R^{2f} 相互独立地具有对 R^e 、 R^f 所给含义;

[0033] R^g 选自氢、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_7 环烷基、 C_3 - C_7 环烷基 - C_1 - C_4 烷基,其中上述两个基团中的 C_3 - C_7 环烷基未被取代或者部分或完全被卤代, C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 卤代炔基、 C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷基、苯基和苄基,其中苯基和苄基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基和 C_1 - C_4 卤代烷氧基的基团取代;

[0034] R^h 选自氢、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_7 环烷基、 C_3 - C_7 环烷基 - C_1 - C_4 烷基,其中上述两个基团中的 C_3 - C_7 环烷基未被取代或者部分或完全被卤代, C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 卤代炔基、 C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷基、基团 $C(=O)-R^k$ 、苯基和苄基,其中苯基和苄基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基和 C_1 - C_4 卤代烷氧基的基团取代;或者

[0035] R^g 、 R^h 与它们所键合的氮原子一起可以形成 5、6 或 7 员饱和或不饱和 N- 键合杂环基团,该杂环基团可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员且未被取代或者可以带

有 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自 = O、卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的基团；

[0036] R^{2g}、R^{2h} 相互独立地具有对 R^g、R^h 所给含义；

[0037] R^k 具有对 R^c 所给含义；

[0038] R^a 选自卤素、Z^a-OH、Z^a-NO₂、Z^a- 氰基、氧代 (= O)、N-R^{q1}、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 炔基、Z^a-C₁-C₄ 烷氧基、Z^a-C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₄ 卤代烷硫基、Z^a-C₁-C₄ 卤代烷氧基、Z^a-C₃-C₁₀ 环烷基、O-Z^a-C₃-C₁₀ 环烷基、Z^a-(三 -C₁-C₄ 烷基) 甲硅烷基、Z^a-S(O)_k-R^{q2}、Z²-C(=O)-R^{q3}、Z²-NR^{q4}R^{q5} 和 Z^a- 苯基，其中 Z^a- 苯基中的苯基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同的基团 R^{q6} 取代；其中

[0039] Z^a 具有对 Z 所给含义之一；

[0040] R^{q1} 为 C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基和 C₃-C₇ 环烷氧基，其未被取代或者部分或完全被卤代；

[0041] R^{q2} 具有对 R^b 所给含义之一；

[0042] R^{q3} 具有对 R^c 所给含义之一；

[0043] R^{q4}、R^{q5} 相互独立地具有对 R^g、R^h 所给含义之一；

[0044] R^{q6} 具有对 R' 所给含义之一。

[0045] 本发明化合物，即式 I 化合物，其 N- 氧化物或其盐尤其可以用于防治不希望的植物生长。因此，本发明还涉及本发明化合物、其 N- 氧化物或盐在防治或防除不希望的植物生长中的用途。

[0046] 本发明还涉及一种包含至少一种本发明化合物—包括其 N- 氧化物或盐—和至少一种助剂的组合物。具体而言，本发明涉及一种包含至少一种本发明化合物—包括其 N- 氧化物或可农用盐—和至少一种常用于作物保护配制剂的助剂的农业组合物。

[0047] 本发明还涉及一种防治或防除不希望的植物生长的方法，该方法包括使除草有效量的至少一种本发明化合物—包括其 N- 氧化物或盐—作用于不希望的植物、其种子和 / 或其生长地。

[0048] 本发明还涉及包括其 N- 氧化物或可农用盐的本发明组合物在防治或防除不希望的植物生长中的用途。

[0049] 取决于取代方式，式 I 化合物可以具有一个或多个手性中心，此时它们作为对映体或非对映体的混合物存在。本发明提供了式 I 化合物的纯对映体或纯非对映体及其混合物二者以及式 I 化合物的纯对映体或纯非对映体或其混合物的本发明用途。合适的式 I 化合物还包括所有可能的几何立体异构体（顺式 / 反式异构体）及其混合物。对于链烯烃、碳 - 氮双键、氮 - 硫双键或酰胺基团可以存在顺式 / 反式异构体。术语“立体异构体”包括光学异构体如对映体或非对映体—后者由于该分子中不止一个手性中心而存在—以及几何异构体（顺式 / 反式异构体）二者。

[0050] 取决于取代方式，式 I 化合物可以以其互变异构体形式存在。因此，本发明还涉及式 I 的互变异构体和所述互变异构体的立体异构体、盐和 N- 氧化物。

[0051] 术语“N- 氧化物”包括具有至少一个氧化成 N- 氧化物结构部分的叔氮原子的任何本发明化合物。化合物 I 的 N- 氧化物尤其可以通过用合适氧化剂如过氧羧酸或其他过氧化物氧化噁二唑环的环氮原子或 6 员芳族环的环氮原子而制备。

[0052] 此外,本发明涉及如本文所定义的化合物,其中一个或多个式 I 中所示原子已经被其稳定的,优选非放射性同位素替代(例如氢被氘替代, ^{12}C 被 ^{13}C 替代, ^{14}N 被 ^{15}N 替代, ^{16}O 被 ^{18}O 替代)以及尤其是其中至少一个氢原子已经被氘原子替代。当然,本发明化合物含有比其天然存在的更多的各同位素,因此同位素无论如何都会存在于化合物 I 中。

[0053] 本发明化合物可以是无定形的或者可以以一种或多种可能具有不同宏观性能如稳定性或显示不同生物学性能如活性的不同结晶状态(多晶形物)存在。本发明包括无定形和结晶的式 I 化合物二者、其对映体或非对映体、各式 I 化合物的不同结晶状态的混合物、其对映体或非对映体,以及其无定形或结晶性盐。

[0054] 本发明化合物的盐为可农用盐。它们可以以常规方法形成,例如若本发明化合物具有碱性官能团的话则通过使该化合物与酸反应或者若本发明化合物具有酸性官能团的话则通过使该化合物与合适碱反应。

[0055] 可农用盐尤其是其阳离子和阴离子分别对本发明化合物的除草作用没有任何不利影响的那些阳离子的盐或那些酸的酸加成盐。合适的阳离子尤其是碱金属的离子,优选锂、钠和钾离子,碱土金属的离子,优选钙、镁和钡离子,以及过渡金属的离子,优选锰、铜、锌和铁离子,以及还有铵(NH_4^+)和其中 1-4 个氢原子被 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 羟基烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、羟基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、苯基或苄基替代的取代铵。取代铵离子的实例包括甲基铵、异丙基铵、二甲基铵、二异丙基铵、三甲基铵、四甲基铵、四乙基铵、四丁基铵、2-羟基乙基铵、2-(2-羟基乙氧基)乙基铵、二(2-羟基乙基)铵、苄基三甲基铵和苄基三乙基铵,此外还有铊离子,铊离子,优选三($\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基)铊,以及氧化铊离子,优选三($\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基)氧化铊。

[0056] 有用酸加成盐的阴离子主要是氯离子、溴离子、氟离子、硫酸氢根、硫酸根、磷酸二氢根、磷酸氢根、磷酸根、硝酸根、碳酸氢根、碳酸根、六氟硅酸根、六氟磷酸根、苯甲酸根以及 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 链烷酸的阴离子,优选甲酸根、乙酸根、丙酸根和丁酸根。它们可以通过使本发明化合物与相应阴离子的酸,优选盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸或硝酸反应而形成。

[0057] 术语“不希望的植物生长”应理解为包括任何在播种的所需作物的农作物位置或场所生长的植物,其中植物生长是任何植物品种,包括播种或所需作物以外的其发芽种子、出苗的秧苗和形成的植物。

[0058] 在各变量的上述定义中提到的有机结构部分像术语卤素一样为各基团成员的单独列举的集合性术语。前缀 $\text{C}_n\text{-C}_m$ 在每种情况下表示该基团中的可能碳原子数。

[0059] 术语“卤素”在每种情况下表示氟、溴、氯或碘,尤其是氟、氯或溴。

[0060] 术语“部分或完全被卤代”用来表示给定基团的一个或多个,例如 1、2、3、4 或 5 个或者全部氢原子已经被卤原子,尤其是氟或氯替代。部分或完全被卤代的基团下文也称为“卤代基团”。例如,部分或完全被卤代的烷基也称为卤代烷基。

[0061] 本文所用(以及在包含烷基的其他基团如烷氧基、烷基羰基、烷氧羰基、烷硫基、烷基磺酰基和烷氧基烷基的烷基结构部分中)的术语“烷基”在每种情况下表示通常具有 1-10 个碳原子,例如 1-8 个碳原子,常常是 1-6 个碳原子,优选 1-4 个碳原子,尤其是 1-3 个碳原子的直链或支化烷基。 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基的实例是甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、2-丁基(仲丁基)、异丁基和叔丁基。 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基的实例除了对 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基提到的那些还有正戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、正己基、1,1-二甲

基丙基、1, 2- 二甲基丙基、1- 甲基戊基、2- 甲基戊基、3- 甲基戊基、4- 甲基戊基、1, 1- 二甲基丁基、1, 2- 二甲基丁基、1, 3- 二甲基丁基、2, 2- 二甲基丁基、2, 3- 二甲基丁基、3, 3- 二甲基丁基、1- 乙基丁基、2- 乙基丁基、1, 1, 2- 三甲基丙基、1, 2, 2- 三甲基丙基、1- 乙基-1- 甲基丙基和 1- 乙基-2- 甲基丙基。 C_1 - C_{10} 烷基的实例除了对 C_1 - C_6 烷基提到的那些还有正庚基、1- 甲基己基、2- 甲基己基、3- 甲基己基、4- 甲基己基、5- 甲基己基、1- 乙基戊基、2- 乙基戊基、3- 乙基戊基、正辛基、1- 甲基辛基、2- 甲基庚基、1- 乙基己基、2- 乙基己基、1, 2- 二甲基己基、1- 丙基戊基、2- 丙基戊基、壬基、癸基、2- 丙基庚基和 3- 丙基庚基。

[0062] 本文所用术语“亚烷基”(或链烷二基)在每种情况下表示如上所定义的烷基,其中在碳骨架的任何位置处的一个氢原子被另一个键合位置替代,由此形成二价结构部分。

[0063] 本文所用(以及在包含卤代烷基的其他基团如卤代烷氧基、卤代烷硫基、卤代烷基羰基、卤代烷基磺酰基和卤代烷基亚磺酰基的卤代烷基结构部分中)的术语“卤代烷基”在每种情况下表示通常具有 1-8 个碳原子(“ C_1 - C_8 卤代烷基”),常常是 1-6 个碳原子(“ C_1 - C_6 卤代烷基”),更常见的是 1-4 个碳原子(“ C_1 - C_{10} 卤代烷基”)的直链或支化烷基,其中该基团的氢原子部分或全部被卤原子替代。优选的卤代烷基结构部分选自 C_1 - C_4 卤代烷基,更优选 C_1 - C_2 卤代烷基,更优选卤代甲基,尤其是 C_1 - C_2 氟烷基。卤代甲基是其中 1、2 或 3 个氢原子被卤原子替代的甲基。实例是溴甲基、氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯一氟甲基、一氯二氟甲基等。 C_1 - C_2 氟烷基的实例是氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、1- 氟乙基、2- 氟乙基、2, 2- 二氟乙基、2, 2, 2- 三氟乙基、五氟乙基等。 C_1 - C_2 卤代烷基的实例除了对 C_1 - C_2 氟烷基提到的那些还有氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、溴甲基、氯氟甲基、二氯一氟甲基、一氯二氟甲基、1- 氯乙基、2- 氯乙基、2, 2- 二氯乙基、2, 2, 2- 三氯乙基、2- 氯-2- 氟乙基、2- 氯-2, 2- 二氟乙基、2, 2- 二氯-2- 氟乙基、1- 溴乙基等。 C_1 - C_4 卤代烷基的实例除了对 C_1 - C_2 卤代烷基提到的那些还有 1- 氟丙基、2- 氟丙基、3- 氟丙基、3, 3- 二氟丙基、3, 3, 3- 三氟丙基、七氟丙基、1, 1, 1- 三氟丙-2- 基、3- 氯丙基、4- 氯丁基等。

[0064] 本文所用(以及在包含环烷基的其他基团如环烷氧基和环烷基烷基的环烷基结构部分中)的术语“环烷基”在每种情况下表示通常具有 3-10 个碳原子(“ C_3 - C_{10} 环烷基”),优选 3-7 个碳原子(“ C_3 - C_7 环烷基”)或尤其是 3-6 个碳原子(“ C_3 - C_6 环烷基”)的单环或双环脂环族基团。具有 3-6 个碳原子的单环基团的实例包括环丙基、环丁基、环戊基和环己基。具有 3-7 个碳原子的单环基团的实例包括环丙基、环丁基、环戊基、环己基和环庚基。具有 7 或 8 个碳原子的双环基团的实例包括双环[2. 1. 1] 己基、双环[2. 2. 1] 庚基、双环[3. 1. 1] 庚基、双环[2. 2. 1] 庚基、双环[2. 2. 2] 辛基和双环[3. 2. 1] 辛基。

[0065] 本文所用(以及在包含卤代环烷基的其他基团如卤代环烷基甲基的卤代环烷基结构部分中)的术语“卤代环烷基”在每种情况下表示通常具有 3-10 个碳原子,优选 3-7 个碳原子或尤其是 3-6 个碳原子的单环或双环脂环族基团,其中至少一个,例如 1、2、3、4 或 5 个氢原子被卤素,尤其是氟或氯替代。实例是 1- 和 2- 氟环丙基,1, 2-、2, 2- 和 2, 3- 二氟环丙基,1, 2, 2- 三氟环丙基,2, 2, 3, 3- 四氟环丙基,1- 和 2- 氯环丙基,1, 2-、2, 2- 和 2, 3- 二氯环丙基,1, 2, 2- 三氯环丙基,2, 2, 3, 3- 四氯环丙基,1-、2- 和 3- 氟环戊基,1, 2-、2, 2-、2, 3-、3, 3-、3, 4-、2, 5- 二氟环戊基,1-、2- 和 3- 氯环戊基,1, 2-、2, 2-、2, 3-、3, 3-、3, 4-、2, 5- 二氯环戊基等。

[0066] 本文所用术语“环烷基烷基”表示如上所定义的环境基,其经由亚烷基与该分子的其余部分键合。术语“ C_3-C_7 环烷基- C_1-C_4 烷基”是指经由如上所定义的 C_1-C_4 烷基与该分子的其余部分键合的如上所定义的 C_3-C_7 环烷基。实例是环丙基甲基、环丙基乙基、环丙基丙基、环丁基甲基、环丁基乙基、环丁基丙基、环戊基甲基、环戊基乙基、环戊基丙基、环己基甲基、环己基乙基、环己基丙基等。

[0067] 本文所用术语“链烯基”在每种情况下表示通常具有 2-8 个碳原子 (“ C_2-C_8 链烯基”),优选 2-6 个碳原子 (“ C_2-C_6 链烯基”),尤其是 2-4 个碳原子 (“ C_2-C_4 链烯基”)和在任意位置的双键的单不饱和直链或支化烃基,例如 C_2-C_4 链烯基,如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基或 2-甲基-2-丙烯基; C_2-C_6 链烯基,如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-1-丁烯基、2-甲基-1-丁烯基、3-甲基-1-丁烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、1,2-二甲基-1-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-1-戊烯基、2-甲基-1-戊烯基、3-甲基-1-戊烯基、4-甲基-1-戊烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-2-戊烯基、4-甲基-2-戊烯基、1-甲基-3-戊烯基、2-甲基-3-戊烯基、3-甲基-3-戊烯基、4-甲基-3-戊烯基、1-甲基-4-戊烯基、2-甲基-4-戊烯基、3-甲基-4-戊烯基、4-甲基-4-戊烯基、1,1-二甲基-2-丁烯基、1,1-二甲基-3-丁烯基、1,2-二甲基-1-丁烯基、1,2-二甲基-2-丁烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,3-二甲基-1-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、1,3-二甲基-3-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-1-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、3,3-二甲基-1-丁烯基、3,3-二甲基-2-丁烯基、1-乙基-1-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-乙基-1-丁烯基、2-乙基-2-丁烯基、2-乙基-3-丁烯基、1,1,2-三甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯基、1-乙基-2-甲基-1-丙烯基、1-乙基-2-甲基-2-丙烯基等,或 C_2-C_8 链烯基,如对 C_2-C_6 链烯基提到的基团以及额外地 1-庚烯基、2-庚烯基、3-庚烯基、1-辛烯基、2-辛烯基、3-辛烯基、4-辛烯基及其位置异构体。

[0068] 也可以表示为“可以被卤素取代的链烯基”的本文所用术语“卤代链烯基”以及卤代链烯氧基等中的卤代链烯基结构部分是指具有 2-8 个 (“ C_2-C_8 卤代链烯基”)或 2-6 个 (“ C_2-C_6 卤代链烯基”)或 2-4 个碳原子 (“ C_2-C_4 卤代链烯基”)和在任意位置的双键的不饱和直链或支化烃基,其中这些基团中的部分或所有氢原子被如上所述的卤原子,尤其是氟、氯和溴替代,例如氯代乙烯基、氯代烯丙基等。

[0069] 本文所用术语“炔基”表示通常具有 2-8 个 (“ C_2-C_8 炔基”),常常是 2-6 个 (“ C_2-C_6 炔基”),优选 2-4 个碳原子 (“ C_2-C_4 炔基”)和在任意位置的一个或两个叁键的不饱和直链或支化烃基,例如 C_2-C_4 炔基,如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基等, C_2-C_6 炔基,如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、3-甲基-1-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基、

1-乙基-2-丙炔基、1-己炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、1-甲基-2-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-3-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、3-甲基-1-戊炔基、3-甲基-4-戊炔基、4-甲基-1-戊炔基、4-甲基-2-戊炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-3-丁炔基、1,2-二甲基-3-丁炔基、2,2-二甲基-3-丁炔基、3,3-二甲基-1-丁炔基、1-乙基-2-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-乙基-3-丁炔基、1-乙基-1-甲基-2-丙炔基等。

[0070] 也表示为“可以被卤素取代的炔基”的本文所用术语“卤代炔基”是指通常具有 3-8 个 (“ C_2-C_8 卤代炔基”)，常常是 2-6 个 (“ C_2-C_6 卤代炔基”)，优选 2-4 个碳原子 (“ C_2-C_4 卤代炔基”)和在任意位置的一个或两个叁键的不饱和直链或支化烃基(如上所述)，其中这些基团中的部分或所有氢原子被如上所述的卤原子，尤其是氟、氯和溴替代。

[0071] 本文所用术语“烷氧基”在每种情况下表示通常具有 1-8 个碳原子 (“ C_1-C_8 烷氧基”)，常常是 1-6 个碳原子 (“ C_1-C_6 烷氧基”)，优选 1-4 个碳原子 (“ C_1-C_4 烷氧基”)的直链或支化烷基，其经由氧原子与该分子的其余部分键合。 C_1-C_2 烷氧基是甲氧基或乙氧基。 C_1-C_4 烷氧基额外例如为正丙氧基、1-甲基乙氧基(异丙氧基)、丁氧基、1-甲基丙氧基(仲丁氧基)、2-甲基丙氧基(异丁氧基)或 1,1-二甲基乙氧基(叔丁氧基)。 C_1-C_6 烷氧基额外例如为戊氧基、1-甲基丁氧基、2-甲基丁氧基、3-甲基丁氧基、1,1-二甲基丙氧基、1,2-二甲基丙氧基、2,2-二甲基丙氧基、1-乙基丙氧基、己氧基、1-甲基戊氧基、2-甲基戊氧基、3-甲基戊氧基、4-甲基戊氧基、1,1-二甲基丁氧基、1,2-二甲基丁氧基、1,3-二甲基丁氧基、2,2-二甲基丁氧基、2,3-二甲基丁氧基、3,3-二甲基丁氧基、1-乙基丁氧基、2-乙基丁氧基、1,1,2-三甲基丙氧基、1,2,2-三甲基丙氧基、1-乙基-1-甲基丙氧基或 1-乙基-2-甲基丙氧基。 C_1-C_8 烷氧基额外例如为庚氧基、辛氧基、2-乙基己氧基及其位置异构体。

[0072] 本文所用术语“卤代烷氧基”在每种情况下表示具有 1-8 个碳原子 (“ C_1-C_8 卤代烷氧基”)，常常是 1-6 个碳原子 (“ C_1-C_6 卤代烷氧基”)，优选 1-4 个碳原子 (“ C_1-C_4 卤代烷氧基”)，更优选 1-3 个碳原子 (“ C_1-C_3 卤代烷氧基”)的如上所定义的直链或支化烷氧基，其中该基团的氢原子部分或全部被卤原子，尤其是氟原子替代。 C_1-C_2 卤代烷氧基例如为 OCH_2F 、 $OCHF_2$ 、 OCF_3 、 OCH_2Cl 、 $OCHCl_2$ 、 $OCCL_3$ 、氯氟甲氧基、二氯一氟甲氧基、一氯二氟甲氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2-溴乙氧基、2-碘乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基或 OC_2F_5 。 C_1-C_4 卤代烷氧基额外例如为 2-氟丙氧基、3-氟丙氧基、2,2-二氟丙氧基、2,3-二氟丙氧基、2-氯丙氧基、3-氯丙氧基、2,3-二氯丙氧基、2-溴丙氧基、3-溴丙氧基、3,3,3-三氟丙氧基、3,3,3-三氯丙氧基、 $OCH_2-C_2F_5$ 、 $OCF_2-C_2F_5$ 、1-(CH_2F)-2-氟乙氧基、1-(CH_2Cl)-2-氯乙氧基、1-(CH_2Br)-2-溴乙氧基、4-氟丁氧基、4-氯丁氧基、4-溴丁氧基或九氟丁氧基。 C_1-C_6 卤代烷氧基额外例如为 5-氟戊氧基、5-氯戊氧基、5-溴戊氧基、5-碘戊氧基、十一氟戊氧基、6-氟己氧基、6-氯己氧基、6-溴己氧基、6-碘己氧基或十二氟己氧基。

[0073] 本文所用术语“烷氧基烷基”在每种情况下表示通常包含 1-6 个碳原子，优选 1-4 个碳原子的烷基，其中 1 个碳原子带有如上所定义的通常包含 1-8 个，优选 1-6 个，尤其是 1-4 个碳原子的烷氧基。“ C_1-C_6 烷氧基- C_1-C_6 烷基”为如上所定义的 C_1-C_6 烷基，其中一个氢原子被如上所定义的 C_1-C_6 烷氧基替代。实例是 CH_2OCH_3 、 $CH_2OC_2H_5$ 、正丙氧基甲基、

CH₂-OCH(CH₃)₂、正丁氧基甲基、(1-甲基丙氧基)甲基、(2-甲基丙氧基)甲基、CH₂-OC(CH₃)₃、2-甲氧基乙基、2-乙氧基乙基、2-正丙氧基乙基、1-(1-甲基乙氧基)乙基、2-正丁氧基乙基、2-(1-甲基丙氧基)乙基、2-(2-甲基丙氧基)乙基、2-(1,1-二甲基乙氧基)乙基、2-甲氧基丙基、2-乙氧基丙基、2-正丙氧基丙基、2-(1-甲基乙氧基)丙基、2-正丁氧基丙基、2-(1-甲基丙氧基)丙基、2-(2-甲基丙氧基)丙基、2-(1,1-二甲基乙氧基)丙基、3-甲氧基丙基、3-乙氧基丙基、3-正丙氧基丙基、3-(1-甲基乙氧基)丙基、3-正丁氧基丙基、3-(1-甲基丙氧基)丙基、3-(2-甲基丙氧基)丙基、3-(1,1-二甲基乙氧基)丙基、2-甲氧基丁基、2-乙氧基丁基、2-正丙氧基丁基、2-(1-甲基乙氧基)丁基、2-正丁氧基丁基、2-(1-甲基丙氧基)丁基、2-(2-甲基丙氧基)丁基、2-(1,1-二甲基乙氧基)丁基、3-甲氧基丁基、3-乙氧基丁基、3-正丙氧基丁基、3-(1-甲基乙氧基)丁基、3-正丁氧基丁基、3-(1-甲基丙氧基)丁基、3-(2-甲基丙氧基)丁基、3-(1,1-二甲基乙氧基)丁基、4-甲氧基丁基、4-乙氧基丁基、4-正丙氧基丁基、4-(1-甲基乙氧基)丁基、4-正丁氧基丁基、4-(1-甲基丙氧基)丁基、4-(2-甲基丙氧基)丁基、4-(1,1-二甲基乙氧基)丁基等。

[0074] 本文所用术语“卤代烷氧基烷基”在每种情况下表示通常包含 1-6 个碳原子,优选 1-4 个碳原子的如上所定义的烷基,其中 1 个碳原子带有通常包含 1-8 个,常常是 1-6 个,尤其是 1-4 个碳原子的如上所定义的卤代烷氧基。实例是氟甲氧基甲基、二氟甲氧基甲基、三氟甲氧基甲基、1-氟乙氧基甲基、2-氟乙氧基甲基、1,1-二氟乙氧基甲基、1,2-二氟乙氧基甲基、2,2-二氟乙氧基甲基、1,1,2-三氟乙氧基甲基、1,2,2-三氟乙氧基甲基、2,2,2-三氟乙氧基甲基、五氟乙氧基甲基、1-氟乙氧基-1-乙基、2-氟乙氧基-1-乙基、1,1-二氟乙氧基-1-乙基、1,2-二氟乙氧基-1-乙基、2,2-二氟乙氧基-1-乙基、1,1,2-三氟乙氧基-1-乙基、1,2,2-三氟乙氧基-1-乙基、2,2,2-三氟乙氧基-1-乙基、五氟乙氧基-1-乙基、1-氟乙氧基-2-乙基、2-氟乙氧基-2-乙基、1,1-二氟乙氧基-2-乙基、1,2-二氟乙氧基-2-乙基、2,2-二氟乙氧基-2-乙基、1,1,2-三氟乙氧基-2-乙基、1,2,2-三氟乙氧基-2-乙基、2,2,2-三氟乙氧基-2-乙基、五氟乙氧基-2-乙基等。

[0075] 本文所用术语“烷硫基”(还有烷基硫基或烷基-S-)在每种情况下表示通常包含 1-8 个碳原子(“C₁-C₈ 烷硫基”),常常包含 1-6 个碳原子(“C₁-C₆ 烷硫基”),优选 1-4 个碳原子(“C₁-C₄ 烷硫基”)的如上所定义的直链或支化饱和烷基,其在该烷基中的任何位置经由硫原子连接。C₁-C₂ 烷硫基为甲硫基或乙硫基。C₁-C₄ 烷硫基额外为例如正丙硫基、1-甲基乙硫基(异丙硫基)、丁硫基、1-甲基丙硫基(仲丁硫基)、2-甲基丙硫基(异丁硫基)或 1,1-二甲基乙硫基(叔丁硫基)。C₁-C₆ 烷硫基额外为例如戊硫基、1-甲基丁硫基、2-甲基丁硫基、3-甲基丁硫基、1,1-二甲基丙硫基、1,2-二甲基丙硫基、2,2-二甲基丙硫基、1-乙基丙硫基、己硫基、1-甲基戊硫基、2-甲基戊硫基、3-甲基戊硫基、4-甲基戊硫基、1,1-二甲基丁硫基、1,2-二甲基丁硫基、1,3-二甲基丁硫基、2,2-二甲基丁硫基、2,3-二甲基丁硫基、3,3-二甲基丁硫基、1-乙基丁硫基、2-乙基丁硫基、1,1,2-三甲基丙硫基、1,2,2-三甲基丙硫基、1-乙基-1-甲基丙硫基或 1-乙基-2-甲基丙硫基。C₁-C₈ 烷硫基额外为例如庚硫基、辛硫基、2-乙基己硫基及其位置异构体。

[0076] 本文所用术语“卤代烷硫基”是指如上所定义的烷硫基,其中氢原子部分或完全被氟、氯、溴和/或碘替代。C₁-C₂ 卤代烷硫基例如为 SCH₂F、SCHF₂、SCF₃、SCH₂Cl、SCHCl₂、SCCl₃、氯氟甲硫基、二氯一氟甲硫基、一氯二氟甲硫基、2-氟乙硫基、2-氯乙硫基、2-溴乙硫基、

2-碘乙硫基、2,2-二氟乙硫基、2,2,2-三氟乙硫基、2-氯-2-氟乙硫基、2-氯-2,2-二氟乙硫基、2,2-二氯-2-氟乙硫基、2,2,2-三氯乙硫基或 SC_2F_5 。 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷硫基额外为例如 2-氟丙硫基、3-氟丙硫基、2,2-二氟丙硫基、2,3-二氟丙硫基、2-氯丙硫基、3-氯丙硫基、2,3-二氯丙硫基、2-溴丙硫基、3-溴丙硫基、3,3,3-三氟丙硫基、3,3,3-三氯丙硫基、 $\text{SCH}_2\text{-C}_2\text{F}_5$ 、 $\text{SCF}_2\text{-C}_2\text{F}_5$ 、1-(CH_2F)-2-氟乙硫基、1-(CH_2Cl)-2-氯乙硫基、1-(CH_2Br)-2-溴乙硫基、4-氟丁硫基、4-氯丁硫基、4-溴丁硫基或九氟丁硫基。 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 卤代烷硫基额外为例如 5-氟戊硫基、5-氯戊硫基、5-溴戊硫基、5-碘戊硫基、十一氟戊硫基、6-氟己硫基、6-氯己硫基、6-溴己硫基、6-碘己硫基或十二氟己硫基。

[0077] 术语“烷基亚磺酰基”和“ S(O)_n -烷基”（其中 n 为 1）是等价的且如本文所用表示如上所定义的经由亚磺酰基 $[\text{S(O)}]$ 连接的烷基。例如，术语“ $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基亚磺酰基”是指如上所定义的经由亚磺酰基 $[\text{S(O)}]$ 连接的 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基。术语“ $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基亚磺酰基”是指如上所定义的经由亚磺酰基 $[\text{S(O)}]$ 连接的 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基。术语“ $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基亚磺酰基”是指如上所定义的经由亚磺酰基 $[\text{S(O)}]$ 连接的 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基。 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基亚磺酰基是甲基亚磺酰基或乙基亚磺酰基。 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基亚磺酰基额外为例如正丙基亚磺酰基、1-甲基乙基亚磺酰基（异丙基亚磺酰基）、丁基亚磺酰基、1-甲基丙基亚磺酰基（仲丁基亚磺酰基）、2-甲基丙基亚磺酰基（异丁基亚磺酰基）或 1,1-二甲基乙基亚磺酰基（叔丁基亚磺酰基）。 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基亚磺酰基额外为例如戊基亚磺酰基、1-甲基丁基亚磺酰基、2-甲基丁基亚磺酰基、3-甲基丁基亚磺酰基、1,1-二甲基丙基亚磺酰基、1,2-二甲基丙基亚磺酰基、2,2-二甲基丙基亚磺酰基、1-乙基丙基亚磺酰基、己基亚磺酰基、1-甲基戊基亚磺酰基、2-甲基戊基亚磺酰基、3-甲基戊基亚磺酰基、4-甲基戊基亚磺酰基、1,1-二甲基丁基亚磺酰基、1,2-二甲基丁基亚磺酰基、1,3-二甲基丁基亚磺酰基、2,2-二甲基丁基亚磺酰基、2,3-二甲基丁基亚磺酰基、3,3-二甲基丁基亚磺酰基、1-乙基丁基亚磺酰基、2-乙基丁基亚磺酰基、1,1,2-三甲基丙基亚磺酰基、1,2,2-三甲基丙基亚磺酰基、1-乙基-1-甲基丙基亚磺酰基或 1-乙基-2-甲基丙基亚磺酰基。

[0078] 术语“烷基磺酰基”和“ S(O)_n -烷基”（其中 n 为 2）是等价的且如本文所用表示如上所定义的经由磺酰基 $[\text{S(O)}_2]$ 连接的烷基。例如，术语“ $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基磺酰基”是指如上所定义的经由磺酰基 $[\text{S(O)}_2]$ 连接的 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基。术语“ $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基磺酰基”是指如上所定义的经由磺酰基 $[\text{S(O)}_2]$ 连接的 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基。术语“ $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基磺酰基”是指如上所定义的经由磺酰基 $[\text{S(O)}_2]$ 连接的 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基。 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基磺酰基是甲基磺酰基或乙基磺酰基。 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基磺酰基额外为例如正丙基磺酰基、1-甲基乙基磺酰基（异丙基磺酰基）、丁基磺酰基、1-甲基丙基磺酰基（仲丁基磺酰基）、2-甲基丙基磺酰基（异丁基磺酰基）或 1,1-二甲基乙基磺酰基（叔丁基磺酰基）。 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基磺酰基额外为例如戊基磺酰基、1-甲基丁基磺酰基、2-甲基丁基磺酰基、3-甲基丁基磺酰基、1,1-二甲基丙基磺酰基、1,2-二甲基丙基磺酰基、2,2-二甲基丙基磺酰基、1-乙基丙基磺酰基、己基磺酰基、1-甲基戊基磺酰基、2-甲基戊基磺酰基、3-甲基戊基磺酰基、4-甲基戊基磺酰基、1,1-二甲基丁基磺酰基、1,2-二甲基丁基磺酰基、1,3-二甲基丁基磺酰基、2,2-二甲基丁基磺酰基、2,3-二甲基丁基磺酰基、3,3-二甲基丁基磺酰基、1-乙基丁基磺酰基、2-乙基丁基磺酰基、1,1,2-三甲基丙基磺酰基、1,2,2-三甲基丙基磺酰基、1-乙基-1-甲基丙基磺酰基或 1-乙基-2-甲基丙基磺酰基。

[0079] 本文所用术语“烷基氨基”在每种情况下表示基团 $-\text{NHR}^*$ ，其中 R^* 为通常具有 1-6

个碳原子 (“C₁-C₆ 烷基氨基”), 优选 1-4 个碳原子 (“C₁-C₄ 烷基氨基”) 的直链或支化烷基。C₁-C₆ 烷基氨基的实例是甲基氨基、乙基氨基、正丙基氨基、异丙基氨基、正丁基氨基、2-丁基氨基、异丁基氨基、叔丁基氨基等。

[0080] 本文所用术语“二烷基氨基”在每种情况下表示基团 -NR*R°, 其中 R* 和 R° 相互独立地为各自通常具有 1-6 个碳原子 (“二-(C₁-C₆ 烷基) 氨基”), 优选 1-4 个碳原子 (“二-(C₁-C₄ 烷基) 氨基”) 的直链或支化烷基。二-(C₁-C₆ 烷基) 氨基的实例是二甲氨基、二乙氨基、二丙氨基、二丁氨基、甲基-乙基氨基、甲基-丙基氨基、甲基-异丙基氨基、甲基-丁基氨基、甲基-异丁基氨基、乙基-丙基氨基、乙基-异丙基氨基、乙基-丁基氨基、乙基-异丁基氨基等。

[0081] 在基团中的后缀“- 羰基”在每种情况下表示该基团经由羰基 (C=O) 与该分子的其余部分键合。这例如在烷基羰基、卤代烷基羰基、氨基羰基、烷基氨基羰基、二烷基氨基羰基、烷氧羰基、卤代烷氧羰基中确实如此。

[0082] 本文所用术语“芳基”是指单环、双环或三环芳族烃基如苯基或萘基, 尤其是苯基。

[0083] 本文所用术语“杂芳基”是指单环、双环或三环杂芳族烃基, 优选单环杂芳族基团, 如吡啶基、嘧啶基等。

[0084] 本文所用术语“含有 1、2、3 或 4 个选自 N、O 和 S 的杂原子作为环成员的 3、4、5 或 6 员单环或 8、9 或 10 员双环饱和、不饱和或芳族杂环”表示单环或双环基团, 该单环或双环基团是饱和、不饱和或芳族的, 其中 N 可以任选被氧化, 即呈 N-氧化物形式, 并且 S 可以任选被氧化成各种氧化态, 即作为 SO 或 SO₂。不饱和杂环含有至少一个 C=C 和 / 或 C=N 和 / 或 N=N 双键。完全不饱和杂环含有与由该环的大小所允许的一样多的共轭 C=C 和 / 或 C=N 和 / 或 N=N 双键。芳族单环杂环是完全不饱和的 5 或 6 员单环杂环。芳族双环杂环是由与苯基环或另一 5 或 6 员杂芳族环稠合的 5 或 6 员杂芳族环构成的 8、9 或 10 员双环杂环。杂环可以经由碳环成员或经由氮环成员与该分子的其余部分连接。当然, 杂环含有至少一个碳环原子。若该环含有不止一个 O 环原子, 则这些原子不相邻。

[0085] 3、4、5 或 6 员单环饱和杂环的实例包括环氧乙烷-2-基、氮丙啶-1-基、氮丙啶-2-基、氧杂环丁烷-2-基、氮杂环丁烷-1-基、氮杂环丁烷-2-基、氮杂环丁烷-3-基、硫杂环丁烷-1-基、硫杂环丁烷-2-基、硫杂环丁烷-3-基、四氢呋喃-2-基、四氢呋喃-3-基、四氢噻吩-2-基、四氢噻吩-3-基、吡咯烷-1-基、吡咯烷-2-基、吡咯烷-3-基、吡唑烷-1-基、吡唑烷-3-基、吡唑烷-4-基、吡唑烷-5-基、咪唑烷-1-基、咪唑烷-2-基、咪唑烷-4-基、**噁**唑烷-2-基、**噁**唑烷-3-基、**噁**唑烷-4-基、**噁**唑烷-5-基、异**噁**唑烷-2-基、异**噁**唑烷-3-基、异**噁**唑烷-4-基、异**噁**唑烷-5-基、噻唑烷-2-基、噻唑烷-3-基、噻唑烷-4-基、噻唑烷-5-基、异噻唑烷-2-基、异噻唑烷-3-基、异噻唑烷-4-基、异噻唑烷-5-基、1, 2, 4-**噁**二唑烷-3-基、1, 2, 4-**噁**二唑烷-5-基、1, 2, 4-噻二唑烷-3-基、1, 2, 4-噻二唑烷-5-基、1, 2, 4-三唑烷-3-基、1, 3, 4-**噁**二唑烷-2-基、1, 3, 4-噻二唑烷-2-基、1, 3, 4-三唑烷-1-基、1, 3, 4-三唑烷-2-基、2-四氢吡喃基、4-四氢吡喃基、1, 3-二**噁**烷-5-基、1, 4-二**噁**烷-2-基、哌啶-1-基、哌啶-2-基、哌啶-3-基、哌啶-4-基、六氢哒嗪-3-基、六氢哒嗪-4-基、六氢嘧啶-2-基、六氢嘧啶-4-基、六氢

嘧啶-5-基、哌嗪-1-基、哌嗪-2-基、1,3,5-六氢三嗪-1-基、1,3,5-六氢三嗪-2-基和1,2,4-六氢三嗪-3-基、吗啉-2-基、吗啉-3-基、吗啉-4-基、硫代吗啉-2-基、硫代吗啉-3-基、硫代吗啉-4-基、1-氧硫代吗啉-2-基、1-氧硫代吗啉-3-基、1-氧硫代吗啉-4-基、1,1-二氧硫代吗啉-2-基、1,1-二氧硫代吗啉-3-基、1,1-二氧硫代吗啉-4-基,氮杂环庚烷-1-、-2-、-3-或-4-基,氧杂环庚烷-2-、-3-、-4-或-5-基,六氢-1,3-二氮杂~~革~~基,六氢-1,4-二氮杂~~革~~基,六氢-1,3-氧氮杂~~革~~基,六氢-1,4-氧氮杂~~革~~基,六氢-1,3-二氧杂~~革~~基,六氢-1,4-二氧杂~~革~~基等。

[0086] 5或6员单环部分不饱和杂环的实例包括2,3-二氢呋喃-2-基、2,3-二氢呋喃-3-基、2,4-二氢呋喃-2-基、2,4-二氢呋喃-3-基、2,3-二氢噻吩-2-基、2,3-二氢噻吩-3-基、2,4-二氢噻吩-2-基、2,4-二氢噻吩-3-基、2-吡咯啉-2-基、2-吡咯啉-3-基、3-吡咯啉-2-基、3-吡咯啉-3-基、2-异噁唑啉-3-基、3-异噁唑啉-3-基、4-异噁唑啉-3-基、2-异噁唑啉-4-基、3-异噁唑啉-4-基、4-异噁唑啉-4-基、2-异噁唑啉-5-基、3-异噁唑啉-5-基、4-异噁唑啉-5-基、2-异噻唑啉-3-基、3-异噻唑啉-3-基、4-异噻唑啉-3-基、2-异噻唑啉-4-基、3-异噻唑啉-4-基、4-异噻唑啉-4-基、2-异噻唑啉-5-基、3-异噻唑啉-5-基、4-异噻唑啉-5-基、2,3-二氢吡唑-1-基、2,3-二氢吡唑-2-基、2,3-二氢吡唑-3-基、2,3-二氢吡唑-4-基、2,3-二氢吡唑-5-基、3,4-二氢吡唑-1-基、3,4-二氢吡唑-3-基、3,4-二氢吡唑-4-基、3,4-二氢吡唑-5-基、4,5-二氢吡唑-1-基、4,5-二氢吡唑-3-基、4,5-二氢吡唑-4-基、4,5-二氢吡唑-5-基、2,3-二氢噁唑-2-基、2,3-二氢噁唑-3-基、2,3-二氢噁唑-4-基、2,3-二氢噁唑-5-基、3,4-二氢噁唑-2-基、3,4-二氢噁唑-3-基、3,4-二氢噁唑-4-基、3,4-二氢噁唑-5-基、3,4-二氢噁唑-2-基、3,4-二氢噁唑-3-基、3,4-二氢噁唑-4-基、2-、3-、4-、5-或6-二-或四氢吡啶基、3-二-或四氢哒嗪基、4-二-或四氢哒嗪基、2-二-或四氢嘧啶基、4-二-或四氢嘧啶基、5-二-或四氢嘧啶基、二-或四氢吡嗪基、1,3,5-二-或四氢三嗪-2-基、1,2,4-二-或四氢三嗪-3-基。

[0087] 5或6员单环芳族杂环的实例是2-呋喃基、3-呋喃基、2-噻吩基、3-噻吩基、1-吡咯基、2-吡咯基、3-吡咯基、1-吡唑基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡唑基、2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基、2-噻唑基、4-噻唑基、5-噻唑基、1-咪唑基、2-咪唑基、4-咪唑基、1,3,4-三唑-1-基、1,3,4-三唑-2-基、2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、1-氧代吡啶-2-基、1-氧代吡啶-3-基、1-氧代吡啶-4-基、3-哒嗪基、4-哒嗪基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、5-嘧啶基和2-吡嗪基。

[0088] 与苯基环或5或6员杂芳族基团耦合的5或6员杂芳族环的实例包括苯并呋喃基、苯并噻吩基、吲哚基、吲唑基、苯并咪唑基、苯并噁噻唑基、苯并噁二唑基、苯并噻二唑基、苯并噁嗪基、喹啉基、异喹啉基、嘌呤基、1,8-二氮杂萘基、蝶啶基、吡啶并[3,2-d]嘧啶基

或吡啶并咪唑基等。

[0089] 下面就式 I 化合物的变量（取代基）的优选实施方案所作说明单独以及优选相互组合有效，并且也与其立体异构体、盐、互变异构体或 N-氧化物组合有效。

[0090] 适用的话，下面就各变量的优选实施方案所作说明进一步就式 I 化合物以及本发明用途和方法及本发明组合物单独以及优选相互组合有效。

[0091] 优选的本发明化合物是如下式 I 化合物或其立体异构体、盐、互变异构体或 N-氧化物，其中该盐为可农用盐。进一步优选的本发明化合物是式 I 化合物或其 N-氧化物或可农用盐。特别优选的本发明化合物是式 I 化合物或其可农用盐。

[0092] 根据本发明的优选实施方案，式 I 化合物中的变量 R 选自氢、氰基、硝基、卤素、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基、C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 卤代链烯基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、C₃-C₇ 环烷基、C(=O)-R^c、C(=O)-OR^d、C(=O)-NR^eR^f、NH-C(=O)R^k 和 NR^gR^h，其中 R^c、R^d、R^e、R^f、R^k、R^g 和 R^h 如上所定义且优选独立地或尤其是组合地具有下列含义：

[0093] R^c 为氢、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基、C₃-C₇ 环烷基、C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 卤代链烯基或苯基，尤其是 C₁-C₄ 烷基或 C₁-C₄ 卤代烷基；

[0094] R^d 为 C₁-C₆ 烷基或 C₁-C₆ 卤代烷基，尤其是 C₁-C₄ 烷基；

[0095] R^e、R^f 相互独立地选自氢、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基和苯基，尤其选自氢和 C₁-C₄ 烷基；或者

[0096] R^e、R^f 与它们所键合的氮原子一起形成 5、6 或 7 员饱和或不饱和 N-键合杂环基团，该杂环基团可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员且未被取代或者可以带有 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、C₁-C₄ 烷基和 C₁-C₄ 卤代烷基的基团，尤其是 R^e、R^f 与它们所键合的氮原子一起可以形成 5、6 或 7 员饱和 N-键合杂环基团，该杂环基团可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员且未被取代或可以带有 1、2、3 或 4 个甲基；

[0097] R^g、R^h 相互独立地选自氢、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基和苯基，尤其选自氢或 C₁-C₄ 烷基，或者

[0098] R^g、R^h 与它们所键合的氮原子一起形成 5、6 或 7 员饱和或不饱和 N-键合杂环基团，该杂环基团可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员且未被取代或者可以带有 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、C₁-C₄ 烷基和 C₁-C₄ 卤代烷基的基团，尤其是 R^g、R^h 与它们所键合的氮原子一起可以形成 5、6 或 7 员饱和 N-键合杂环基团，该杂环基团可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员且未被取代或可以带有 1、2、3 或 4 个甲基；

[0099] R^k 为 H、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基或苯基，尤其是 C₁-C₄ 烷基。

[0100] 根据更优选的实施方案，式 I 化合物的变量 R 选自卤素、氰基、硝基、NH₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、C₃-C₇ 环烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C(=O)-R^c、C(=O)-OR^d、C(=O)-NR^eR^f 和 NH-C(=O)R^k，其中 R^c、R^d、R^e、R^f 和 R^k 如上所定义且优选独立地或尤其是组合地具有下列含义：

[0101] R^c 为 C₁-C₄ 烷基或 C₁-C₄ 卤代烷基，

[0102] R^d 为 C₁-C₄ 烷基，

[0103] R^e 为氢或 C₁-C₄ 烷基，

[0104] R^f 为氢或 C₁-C₄ 烷基，或者

[0105] R^e、R^f 与它们所键合的氮原子一起可以形成 5、6 或 7 员饱和 N-键合杂环基团，该

杂环基团可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员且未被取代或可以带有 1、2、3 或 4 个甲基, 以及

[0106] R^k 为 C_1-C_4 烷基。

[0107] R 还优选选自氢和 $C(=O)-R^c$, 其中 R^c 如上所定义并且其中 R^c 尤其为 C_1-C_4 烷基, 如甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、2-丁基或叔丁基, C_1-C_4 卤代烷基, C_3-C_6 环烷基如环丙基、环丁基、环戊基、环己基; C_2-C_6 链烯基, 如 $CH_2CH=CH_2$ 或 $CH_2CH=CH_2$; C_2-C_6 炔基如 2-丙炔基; 苯基; 被 1、2 或 3 个选自卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基, 尤其是卤素和 C_1-C_4 烷基取代的苯基, 如 2-甲基苯基、4-甲基苯基、2-乙基苯基、4-乙基苯基、2-氟苯基或 4-氟苯基; 杂环基, 其中杂环基为含有 1、2、3 或 4 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的 5 或 6 员单环饱和、部分不饱和或芳族杂环, 其中杂环基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的基团取代, 尤其是具有 1 或 2 个选自 O、S 和 N 的杂原子作为环成员的 5 或 6 员杂芳基如吡啶基或具有 1 或 2 个选自 O、S 和 N 的杂原子作为环成员以及其中杂芳基带有 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的基团的 5 或 6 员杂芳基, 如被 1、2 或 3 个选自 C_1-C_4 烷基的基团取代的吡啶基。R 还优选为 $NH-C(=O)R^k$, 其中 R^k 为苯基。

[0108] 根据本发明的特别优选实施方案, 式 I 化合物中的变量 R 选自氢, 卤素, 氰基, 硝基, 氨基, C_1-C_4 烷基, C_1-C_4 卤代烷基, C_3-C_7 环烷基, C_1-C_4 烷氧基- C_1-C_4 烷基, $C(=O)-C_1-C_4$ 烷基, $C(=O)-C_1-C_4$ 卤代烷基, $C(=O)-C_3-C_6$ 环烷基, $C(=O)-C_2-C_6$ 链烯基, $C(=O)-C_2-C_6$ 炔基, 苯甲酰基, 被 1 或 2 个选自 C_1-C_4 烷基和卤素的基团取代的苯甲酰基, 其中杂芳基具有 1 个氮原子作为环成员的 $C(=O)$ -杂芳基, $C(=O)-O-C_1-C_4$ 烷基, $C(=O)NH_2$, $C(=O)NH(C_1-C_4$ 烷基), $C(=O)N(C_1-C_4$ 烷基)₂, 其中 R^e 和 R^f 与它们所键合的氮原子一起可以形成可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员且未被取代或者可以带有 1、2、3 或 4 个甲基的 5 或 6 员饱和 N-键合杂环基团的 $C(=O)-NR^eR^f$, 苯甲酰氨基和 $NH-C(=O)-C_1-C_4$ 烷基。

[0109] 在该实施方案中, 式 I 化合物中的变量 R 的具体实例是 H、Cl、Br、F、氰基、硝基、氨基、甲基、乙基、正丙基、异丙基、叔丁基、 CF_3 、 CHF_2 、 CH_2F 、 CH_2CF_3 、 CF_2CF_3 、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、甲氧基乙基、甲氧基甲基、甲基羰基、乙基羰基、异丙基羰基、叔丁基羰基、三氟甲基羰基、环丙基羰基、环戊基羰基、环己基羰基、烯丙基羰基、(2-丙炔基)羰基、苯甲酰基、2-甲基苯甲酰基、4-甲基苯甲酰基、2-氟苯甲酰基、4-氟苯甲酰基、吡啶-2-基、甲氧基羰基、乙氧羰基、氨基羰基、甲基氨基羰基、二甲氨基羰基、哌啶基羰基、甲氧基羰基、乙氧羰基、乙酰氨基和苯甲酰氨基。

[0110] 根据本发明的另一优选实施方案, 式 I 化合物中的变量 R 为苯基或杂环基, 其中杂环基为含有 1、2、3 或 4 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的 5 或 6 员单环或 8、9 或 10 员双环饱和、部分不饱和或芳族杂环, 其中苯基和杂环基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个如上所定义的相互独立地优选选自卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷氧基- C_1-C_4 烷基和 C_1-C_6 卤代烷氧基的基团 R' 取代。 R' 尤其选自卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_4 卤代烷基和 C_1-C_4 烷氧基, 具体选自 Cl、F、Br、甲基、乙基、甲氧基和三氟甲基。

[0111] 更优选 R 为苯基或杂环基,其中杂环基为含有 1、2、3 或 4 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的 5 或 6 员单环或 8、9 或 10 员双环饱和、部分不饱和或芳族杂环,其中苯基和杂环基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个基团 R' 取代,其中 R' 如上所定义且尤其选自卤素、甲基、乙基、甲氧基和三氟甲基。

[0112] 根据本发明的更优选实施方案,式 I 化合物中的变量 R 为未被取代或者被 1、2、3 或 4 个基团 R' 取代的苯基,其中 R' 如上所定义且尤其选自卤素、甲基、乙基、甲氧基和三氟甲基。

[0113] 根据本发明的进一步更优选实施方案,式 I 化合物中的变量 R 为杂环基,其中杂环基为含有 1、2、3 或 4 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的饱和、部分不饱和或芳族 5 或 6 员单环或 9 或 10 员双环杂环,其中该双环杂环由与苯基环稠合的 5 或 6 员杂芳族环构成,并且其中杂环基未被取代或者被 1、2、3 或 4 个如上所定义且尤其相互独立地选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基和 C₁-C₆ 卤代烷氧基的基团 R' 取代。R' 尤其选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₁-C₄ 卤代烷基和 C₁-C₄ 烷氧基,具体选自 Cl、F、Br、甲基、乙基、甲氧基和三氟甲基。

[0114] 根据本发明的特别优选实施方案,式 I 化合物中的变量 R 为选自如下的杂环基:四氢呋喃-2-基、四氢呋喃-3-基、哌啶-2-基、哌啶-3-基、哌啶-4-基、呋喃-2-基、呋喃-3-基、噻吩-2-基、噻吩-3-基、吡咯-2-基、吡咯-3-基、吡唑-3-基、吡唑-4-基、吡唑-5-基、咪唑-2-基、咪唑-4-基、咪唑-5-基、异噁唑-2-基、异噁唑-3-基、异噁唑-4-基、异噁唑-5-基、噁唑-2-基、噁唑-3-基、噁唑-4-基、噁唑-5-基、异噻唑-3-基、异噻唑-4-基、异噻唑-5-基、噻唑-2-基、噻唑-4-基、噻唑-5-基、1,2,3-三唑-4-基、1,2,3-三唑-5-基、1,2,5-三唑-3-基、1,3,4-三唑-2-基、1,2,4-三唑-3-基、1,2,4-三唑-5-基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-三唑-3-基、1,3,4-噁二唑-2-基、1,2,3-噁二唑-4-基、1,2,3-噁二唑-5-基、1,2,5-噁二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1,3,4-噻二唑-2-基、1,2,3-噻二唑-4-基、1,2,3-噻二唑-5-基、1,2,5-噻二唑-3-基、2H-1,2,3,4-四唑-5-基、1H-1,2,3,4-四唑-1-基、1,2,3,4-噁三唑-5-基、1,2,3,5-噁三唑-4-基、1,2,3,4-噻三唑-5-基、1,2,3,5-噻三唑-4-基、苯并异噁唑-2-基、吡啶-2-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、吡嗪-2-基、吡嗪-3-基、嘧啶-2-基、嘧啶-4-基、嘧啶-5-基、哒嗪-3-基和哒嗪-4-基,其中杂环基未被取代或者带有 1、2 或 3 个相互独立地具有上述优选含义的基团 R'。

[0115] 根据本发明的进一步优选实施方案,式 I 化合物中的变量 R 为 C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 卤代链烯基、C₂-C₆ 炔基或 C₂-C₆ 卤代炔基。在该实施方案中,R 尤其为 CH₂CH=CH₂ 或 2-丙炔基。

[0116] 根据本发明的进一步优选实施方案,式 I 化合物中的变量 R 为基团 OR^a,其中 R^a 选自 H、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基、C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 卤代链烯基、C₂-C₆ 炔基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基和 C₃-C₇ 环烷基,其未被取代或者部分或完全被卤代。R^a 还可以选自 C₂-C₆ 卤

代炔基。更优选 R^a 选自 H 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 卤代链烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_2-C_4 卤代炔基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基和 C_3-C_6 环烷基。在该实施方案中， R^a 具体为 H 、甲基、乙基、正丙基、异丙基、 $C(CH_3)_3$ 、 CH_2Cl 、 CHF_2 、 CF_3 、 $CH_2CH=CH_2$ 、2-丙炔基、 CH_2OCH_3 、 $CH_2CH_2OCH_3$ 、 $CH_2CH_2OCH_2CH_3$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基。

[0117] 根据本发明的进一步优选实施方案，式 I 化合物中的变量 R 为 $S(O)_n-R^b$ ，其中 n 为 0、1 或 2 且 R^b 选自 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_2-C_6 链烯基、 C_2-C_6 卤代链烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_2-C_6 卤代炔基、 C_3-C_7 环烷基、苯基和杂环基，其中杂环基为含有 1、2 或 3 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的 5 或 6 员单环饱和、部分不饱和或芳族杂环，其中苯基和杂环基未被取代或被 1、2 或 3 个相同或不同且选自卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_2 卤代烷基和 C_1-C_2 烷氧基的基团取代。

[0118] 根据本发明的更优选实施方案，式 I 化合物中的变量 R 为 $S(O)_n-R^b$ ，其中 n 为 0、1 或 2 且 R^b 选自 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_2-C_6 链烯基、 C_2-C_6 卤代链烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_7 环烷基、苯基和杂环基，其中杂环基为具有 1 或 2 个氮原子作为环成员的 6 员芳族杂环基团。

[0119] 根据本发明的特别优选实施方案，式 I 化合物中的变量 R 为 $S-R^b$ 、 $S(O)-R^b$ 或 $S(O)_2-R^b$ ，其中 R^b 各自如上所定义且尤其选自 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 链烯基和 C_2-C_6 炔基，具体选自 CH_3 、 CH_2CH_3 、 $CH(CH_3)_2$ 、 $CH_2CH_2CH_3$ 、 $CH_2CH=CH_2$ 、2-丙炔基和苯基。

[0120] 在本发明的特殊实施方案中，式 I 化合物中的变量 R 选自 CH_3 、 CH_2CH_3 、 $CH(CH_3)_2$ 、 $CH_2CH_2CH_3$ 、 $C(CH_3)_3$ 、 CH_2Cl 、 OCH_3 、 CF_3 、 CN 、 Cl 和 SO_2CH_3 。

[0121] 本发明的优选化合物是如下式 I 化合物，其中 R^3 选自氢、氰基、卤素、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_2-C_4 链烯氧基、 C_2-C_4 炔氧基和 $S(O)_kR^{2b}$ ，其中变量 k 和 R^{2b} 具有本文所定义的含义之一。

[0122] 更优选 R^3 选自氢、卤素、 CN 、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 卤代烷硫基、 $S(O)_2-C_1-C_4$ 烷基和 $S(O)_2-C_1-C_4$ 卤代烷基。

[0123] R^3 尤其选自氢、卤素、 CN 、 NO_2 、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 卤代烷基、 C_1-C_2 烷氧基、 C_1-C_2 卤代烷氧基、 C_1-C_2 烷硫基、 C_1-C_2 卤代烷硫基、 $S(O)_2-C_1-C_2$ 烷基和 $S(O)_2-C_1-C_2$ 卤代烷基，具体选自氢、 F 、 Cl 、 Br 、 CN 、 NO_2 、 CH_3 、 C_2H_5 、 CF_3 、 CHF_2 、 OCH_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 SCH_3 、 SCF_3 、 $SCHF_2$ 、 $S(O)_2CH_3$ 和 $S(O)_2CH_2CH_3$ 。

[0124] 根据本发明的具体实施方案，式 I 化合物中的变量 R^3 选自氰基、卤素、 C_1-C_4 卤代烷基和 C_1-C_4 烷基磺酰基，如氰基、氯、三氟甲基、二氟甲基、 $S(O)_2CH_3$ 和 $S(O)_2CH_2CH_3$ 。

[0125] 在一组具体实施方案中，式 I 化合物中的变量 R^3 选自氯、溴、三氟甲基、甲基磺酰基和氰基。

[0126] 本发明的优选化合物是如下式 I 化合物，其中 R^5 选自氢、氰基、卤素、硝基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 卤代烷基。 R^5 尤其选自氢、 CHF_2 、 CF_3 、 CN 、 NO_2 、 CH_3 和卤素。根据本发明的特殊实施方案，式 I 化合物中的变量 R^5 选自氢和卤素，尤其是氢、氟和氯。

[0127] 一组特殊的本发明化合物是如下式 I 化合物，其中 X^1 为 CR^1 。 R^1 优选选自氰基、卤素、硝基、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 链烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 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、 $Z^1-C_1-C_4$ 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基、 $Z^1-C_1-C_4$ 烷硫基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_2-C_6 链烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧

基、 C_1-C_4 卤代烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷氧基和 $S(O)_k R^{1b}$, 其中 k 、 R^{1b} 和 Z^1 如本文所定义以及其中 R^{1b} 尤其选自 C_1-C_4 烷基和 C_1-C_4 卤代烷基。就此而言, Z^1 尤其为共价键。就此而言, k 尤其为 2。

[0128] 更优选 R^1 选自氰基、硝基、卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷基、 C_1-C_4 卤代烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷基、 C_1-C_4 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷基、 C_1-C_4 烷硫基 $-C_1-C_4$ 烷基、 C_1-C_4 烷硫基 $-C_1-C_4$ 烷硫基 $-C_1-C_4$ 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 卤代烷硫基、 C_3-C_4 链烯氧基、 C_3-C_4 炔氧基、 C_1-C_4 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷氧基、 $S(O)_2-C_1-C_4$ 烷基和 $S(O)_2-C_1-C_4$ 卤代烷基。根据进一步更优选的实施方案, R^1 还可以选自硝基和氰基。

[0129] 甚至更优选 R^1 选自氰基、硝基、卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 卤代烷硫基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷基、 C_1-C_4 卤代烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷基、 C_1-C_4 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷基和 C_1-C_4 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷氧基。

[0130] R^1 尤其选自卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 卤代烷硫基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷基和 C_1-C_4 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷基。 R^1 尤其还可以选自硝基、氰基、 C_1-C_4 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷基。

[0131] 具体而言, R^1 为 F、Cl、Br、 NO_2 、 CH_3 、 CF_3 、 OCH_3 、 OCF_3 、 SCF_3 、 SO_2CH_3 、 $OCH_2CH_2OCH_3$ 、 $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ 或 $CH_2OCH_2CF_3$ 。

[0132] 根据本发明的特殊实施方案, 式 I 化合物中的变量 R^1 选自卤素、硝基、氰基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基和 C_1-C_4 烷基磺酰基。实例是氯、氟、溴、硝基、氰基、甲基、三氟甲基和甲基磺酰基。

[0133] 根据本发明的另一实施方案, R^1 优选选自 Z^1 -苯氧基和 Z^1 -杂环氧基, 其中杂环氧基为含有 1、2、3 或 4 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的氧键合的 5 或 6 员单环或 8、9 或 10 员双环饱和、部分不饱和或芳族杂环, 其中苯氧基和杂环氧基中的环状基团未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同的基团 R^{11} 取代。

[0134] 尤其优选如下式 I 化合物, 其中

[0135] R^1 选自卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷基、 C_1-C_4 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 卤代烷硫基和 C_1-C_4 烷基磺酰基, 尤其选自 F、Cl、Br、 CH_3 、 CF_3 、 OCH_3 、 SCH_3 、 OCF_3 、 SCF_3 、 SO_2CH_3 、 CH_2OCH_3 和 $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$; 以及

[0136] R^3 选自氢、卤素、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷硫基和 C_1-C_4 烷基磺酰基, 尤其选自 H、Cl、Br、CN、 NO_2 、 CH_3 、 CF_3 、 CHF_2 、 OCH_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 SCH_3 、 SCF_3 、 $SCHF_2$ 、 $S(O)_2CH_3$ 和 $S(O)_2CH_2CH_3$ 。

[0137] 本发明的另一实施方案涉及如下式 I 化合物、其 N-氧化物及其盐, 其中 X^1 为 N。

[0138] 本发明的另一实施方案涉及如下式 I 化合物、其 N-氧化物及其盐, 其中 X^2 为 CR^2 。优选的本发明化合物为如下式 I 化合物, 其中 R^2 具有上面对 R^2 所给任意含义之一, 氢除外。

[0139] 本发明的特殊实施方案涉及如下式 I 化合物, 其中 X^2 为 CR^2 以及其中变量 R^2 为 Z^{2a} -杂环基, 其中 Z^{2a} 如本文所定义并且其中杂环基为含有 1、2、3 或 4 个选自 O、N 和 S 的

杂原子作为环成员的 5 或 6 员单环或 8、9 或 10 员双环饱和、部分不饱和或芳族杂环,其中 Z^{2a} - 苯基和 Z^{2a} - 杂环基中的环状基团未被取代或者被 1、2、3 或 4 个相同或不同的基团 R^{21} 取代。

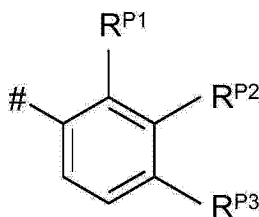
[0140] 在其中式 I 中的 X^2 为 CR^2 的本发明化合物中,变量 R^2 优选为 5 或 6 员杂环基,其中杂环基为含有 1 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员且含有 0、1 或 2 个另外的氮原子的饱和、部分不饱和或芳族杂环基团,其中杂环基未被取代或者带有 1、2 或 3 个相同或不同的基团 R^{21} 。在该实施方案中, R^{21} 优选选自卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷硫基和 C_1 - C_4 烷硫基- C_1 - C_4 烷基。 R^{21} 尤其选自氟、氯、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、甲基硫基、甲基磺酰基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、乙基硫基甲基、乙基硫基乙基、甲基硫基甲基、甲基硫基乙基、氟甲基、二氟甲基和三氟甲基。

[0141] 根据本发明的甚至更优选实施方案, X^2 为 CR^2 且变量 R^2 为选自异噁唑啉基、1,2-二氢四唑啉酮基、1,4-二氢四唑啉酮基、四氢呋喃基、二氧戊环基、哌啶基、吗啉基、哌嗪基、异噁唑基、吡唑基、噻唑基、噁唑基、呋喃基、吡啶基和吡嗪基的 5 或 6 员杂环基,其中杂环基未被取代或者带有 1、2 或 3 个选自 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 烷硫基- C_1 - C_4 烷基的相同或不同基团 R^{21} 。 R^2 的尤其优选含义是 4,5-二氢异噁唑-3-基、5-甲基-4,5-二氢异噁唑-3-基、5-氟甲基-4,5-二氢异噁唑-3-基、5-二氟甲基-4,5-二氢异噁唑-3-基、4,5-二氢异噁唑-5-基、3-甲基-4,5-二氢异噁唑-5-基、3-甲氧基-4,5-二氢异噁唑-5-基、3-甲氧基甲基-4,5-二氢异噁唑-5-基、3-甲基硫基甲基、4,5-二氢异噁唑-5-基、1-甲基-5-氧代-1,5-二氢四唑-2-基、4-甲基-5-氧代-4,5-二氢四唑-1-基、吗啉-4-基、异噁唑-3-基、5-甲基异噁唑-3-基、异噁唑-5-基、3-甲基异噁唑-5-基、1-甲基-1H-吡唑-3-基、2-甲基-2H-吡唑-3-基和噻唑-2-基。

[0142] 在式 I 中的 X^2 为 CR^2 的本发明化合物中,变量 R^2 还可以为 Z^{2a} - 苯基,其中 Z^{2a} 如本文所定义以及其中苯基未被取代或者带有 1、2 或 3 个相同或不同的基团 R^{21} 。根据优选实施方案, Z^{2a} 为共价键。根据另一优选实施方案, Z^{2a} 为 C_1 - C_4 链烷二基-0,如 OCH_2 或 OCH_2CH_2 。根据另一优选实施方案, Z^{2a} 为 O - C_1 - C_4 链烷二基,如 CH_2O 或 CH_2CH_2O 。根据另一优选实施方案, Z^{2a} 为 C_1 - C_4 链烷二基- O - C_1 - C_4 链烷二基。在该实施方案中, R^{21} 优选选自卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷氧基,优选卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_2 卤代烷基和 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷氧基,如氟、氯、溴、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、 OCH_2OCH_3 、 $OCH_2CH_2OCH_2CH_3$ 、 $OCH_2OCH_2CH_3$ 或 $OCH_2CH_2OCH_3$ 。苯基尤其未被取代或者带有 1 个基团 R^{21} 。

[0143] 在其中 X 为 $C-R^2$ 的式 I 化合物中的变量 R^2 尤其可以为下式的基团:

[0144]



[0145] 其中 # 表示基团 R² 通过其连接的键, 以及

[0146] R^{P1} 为氢或卤素, 优选 H、Cl、Br 或 F, 尤其是 H 或 F;

[0147] R^{P2} 为氢、卤素或 C₁-C₂ 烷氧基, 优选 H、Cl、Br、F、OCH₃ 或 OCH₂CH₃, 尤其是 H、F、Cl 或 OCH₃; 以及

[0148] R^{P3} 为氢、卤素、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 卤代烷基、C₁-C₂ 烷氧基、C₁-C₂ 烷氧基 -C₁-C₂ 烷氧基, 优选 H、Cl、Br、F、CH₃、C₂H₅、CF₃、CHF₂、CH₂F、CCl₂F、CF₂Cl、CH₂CF₃、CH₂CHF₂、CF₂CF₃、OCH₃、OCH₂CH₃、OCH₂OCH₃、OCH₂CH₂OCH₂CH₃、OCH₂OCH₂CH₃ 或 OCH₂CH₂OCH₃, 尤其是 H、F、Cl、CH₃、CF₃、OCH₃、OCH₂CH₃、OCH₂OCH₃ 或 OCH₂CH₂OCH₃。

[0149] 根据本发明的特殊实施方案, 式 I 化合物中的变量 R² 为未被取代或者带有一个基团 R²¹ 的苯基, 其中 R²¹ 连接于苯基环的 4 位且选自卤素、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₂ 卤代烷基和 C₁-C₂ 烷氧基 -C₁-C₂ 烷氧基, 优选选自氟、氯、溴、CH₃、C₂H₅、OCH₃、OC₂H₅、CHF₂、CF₃、OCH₂OCH₃ 和 OCH₂CH₂OCH₃, 具体选自 OCH₃ 和 OC₂H₅。

[0150] 在其中式 I 中的 X² 为 CR² 的本发明化合物中, 特殊实施方案涉及如下化合物, 其中变量 R² 选自卤素、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 炔基、C₂-C₄ 烷氧基、C₂-C₄ 卤代烷氧基、C₃-C₆ 链烯氧基、C₃-C₆ 炔氧基、C₁-C₄ 烷氧羰基、S(O)₂-C₁-C₄ 烷基和 S(O)₂-C₁-C₄ 卤代烷基。更优选 R² 选自 C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₂-C₄ 烷氧基、C₁-C₂ 卤代烷氧基 -C₁-C₂ 烷基、C₃-C₄ 链烯氧基、C₃-C₄ 炔氧基、C₁-C₄ 烷氧羰基和 S(O)₂-C₁-C₄ 烷基, 尤其选自 CH=CH₂、CH=CHCH₃、OC₂H₅、CH₂OCH₂CF₃、OCH₂CH=CH₂、OCH₂C≡CH、C(O)OCH₃、C(O)OC₂H₅、SO₂CH₃、SO₂C₂H₅ 和 SO₂CH(CH₃)₂。

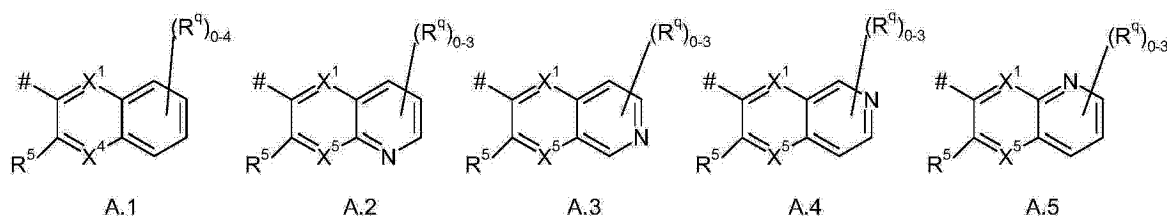
[0151] 根据本发明的另一组优选实施方案, X 为 C-R², 其中 R² 与 R³ 一起或者若存在的话与 R¹ 一起形成稠合 5、6、7、8、9 或 10 员碳环或稠合 5、6、7、8、9 或 10 员杂环, 其中稠合杂环具有 1、2、3 或 4 个选自 O、S 和 N 的杂原子作为环成员, 其中稠合碳环和稠合杂环是单环或双环的且其中稠合碳环和稠合杂环未被取代或者带有 1、2、3、4、5、6、7、8、9 或 10 个基团 R^q。

[0152] 根据本发明的特殊实施方案, X 为 C-R², 其中 R² 与 R³ 一起或者若存在的话与 R¹ 一起形成稠合 5、6、7、8、9 或 10 员碳环或稠合 5、6、7、8、9 或 10 员杂环, 其中稠合杂环具有 1、2、3 或 4 个选自 O、S 和 N 的杂原子作为环成员, 其中稠合碳环和稠合杂环是单环或双环的且其中稠合碳环和稠合杂环未被取代或者带有 1、2、3、4、5、6、7、8、9 或 10 个基团 R^q。环成员 S 可以任选被氧化成各种氧化态。环成员 N 可以任选被氧化。与它们所连接的 6 员 N-杂芳族基团得到 9-15 员双环或三环体系。在该实施方案中, 杂芳族基团优选稠合于苯、萘、C₅-C₁₀ 环烷烃或具有 5-10 个环成员的杂环。其中 R² 与 R³ 一起或与 R¹ 一起形成如上所定义的稠合 5、6、7、8、9 或 10 员碳环或稠合 5、6、7、8、9 或 10 员杂环的环体系实例是喹啉、异喹啉、喹喔啉、苯并 [g] 异喹啉、5, 6, 7, 8, - 四氢异喹啉、5, 8- 二氢异喹啉、1, 5- 二氮杂萘、1, 6- 二氮杂萘、2, 6- 二氮杂萘、1, 7- 二氮杂萘、2, 7- 二氮杂萘、1, 8- 二氮杂萘、吡啶并 [2, 3-b] 吡嗪、吡啶并 [3, 4-b] 吡嗪、6, 7- 二氢 -5H-[2] 氮茚 (pyrindine)、5H-[2] 氮茚、2, 3- 二氢 -1H- 吡咯

并 [3, 2-c] 吡啶、1H-吡咯并 [3, 2-c] 吡啶、2, 3-二氢呋喃并 [3, 2-c] 吡啶、呋喃并 [3, 2-c] 吡啶、2, 3-二氢噻吩并 [3, 2-c] 吡啶、噻吩并 [3, 2-c] 吡啶、[1, 3] 二氧杂环戊烯并 [4, 5-c] 吡啶、1H-咪唑并 [4, 5-c] 吡啶、6, 7-二氢-5H-[1] 氮茚、5H-[1H] 氮茚、7H-[1H] 氮茚、5H-环戊二烯并吡嗪、6, 7-二氢-5H-环戊二烯并吡嗪、喹啉等。

[0153] 本发明的特殊实施方案涉及如下式 I 化合物, 其中 X 为 C-R² 且其中 R² 与 R³ 一起形成如上所定义的稠合 5、6、7、8、9 或 10 员碳环或稠合 5、6 或 7 员杂环。实例是基团 A. 1、A. 2、A. 3、A. 4 和 A. 5:

[0154]

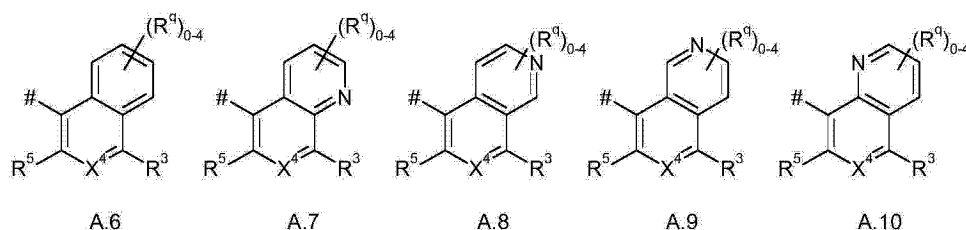


[0155] # 表示与 1, 2, 5-噁二唑-3-基氨基羰基的羰基碳原子的键;

[0156] X¹、X⁴、R⁵ 和 R^q 如上所定义。

[0157] 本发明的的其他特殊实施方案涉及如下式 I 化合物, 其中 X 为 C-R² 且其中 R² 与 R¹ 一起形成如上所定义的稠合 5、6、7、8、9 或 10 员碳环或稠合 5、6 或 7 员杂环。实例是基团 A. 6、A. 7、A. 8、A. 9 和 A. 10:

[0158]



[0159] # 表示与 1, 2, 5-噁二唑-3-基氨基羰基的羰基碳原子的键;

[0160] X⁴ 为 N 且 R³、R⁵ 和 R^q 如上所定义; 以及

[0161] 根据本发明的进一步优选实施方案, X² 为 N。

[0162] 根据本发明的进一步优选实施方案, X⁴ 为 CR⁴。根据本发明的该实施方案, R⁴ 优选选自氢、卤素、氰基、硝基、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 卤代烷基。R⁴ 尤其选自氢、CHF₂、CF₃、CN、NO₂、CH₃ 和卤素。

[0163] 就此而言, 变量 R', R¹¹、R²¹、Z、Z¹、Z²、Z^{2a}、R^b、R^{1b}、R^{2b}、R^c、R^{2c}、R^d、R^{2d}、R^e、R^f、R^{2e}、R^{2f}、R^g、R^h、R^{2g}、R^{2h}、R^k、n 和 k 相互独立地优选具有下列含义之一:

[0164] R', R¹¹、R²¹ 相互独立地选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷氧基-C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷硫基-C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基-C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基, 更优选选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₁-C₄ 卤代烷基和 C₁-C₄ 烷氧基, 尤其选自 Cl、F、Br、甲基、乙基、甲氧基和三氟甲基。

[0165] Z、Z¹、Z² 相互独立地选自共价键、亚甲基和亚乙基。

[0166] Z^{2a} 选自共价键、C₁-C₂ 链烷二基、O-C₁-C₂ 链烷二基、C₁-C₂ 链烷二基-O 和 C₁-C₂ 链

烷二基 -O-C₁-C₂ 链烷二基 ;更优选选自共价键、亚甲基、亚乙基、O- 亚甲基、O- 亚乙基、亚甲基 -O 和亚乙基 -O ;尤其选自共价键、亚甲基和亚乙基。

[0167] R^b、R^{1b}、R^{2b} 相互独立地选自 C₁-C₆ 烷基、C₃-C₇ 环烷基、C₁-C₆ 卤代烷基、C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 卤代链烯基、C₂-C₆ 炔基、C₂-C₆ 卤代炔基、苯基和杂环基,其中杂环基含有 1、2 或 3 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的 5 或 6 员单环饱和、部分不饱和或芳族杂环,其中苯基和杂环基未被取代或者被 1、2 或 3 个相同或不同且选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₂ 卤代烷基和 C₁-C₂ 烷氧基的基团取代。

[0168] 更优选 R^b、R^{1b}、R^{2b} 相互独立地选自 C₁-C₄ 烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 卤代炔基、C₃-C₆ 环烷基、苯基和杂环基,其中杂环基为含有 1、2 或 3 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的 5 或 6 员单环饱和、部分不饱和或芳族杂环。

[0169] R^b、R^{1b}、R^{2b} 尤其相互独立地选自 C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₃-C₆ 环烷基、苯基和杂环基,其中杂环基为具有 1 或 2 个氮原子作为环成员的 5 或 6 员芳族杂环基团。

[0170] R^c、R^{2c} 和 R^k 相互独立地选自氢、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基、C₃-C₇ 环烷基,其未被取代或者部分或完全被卤代, C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 卤代链烯基、C₂-C₆ 炔基、C₂-C₆ 卤代炔基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、苯基、苄基和杂环基,其中杂环基为含有 1、2 或 3 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的 5 或 6 员单环饱和、部分不饱和或芳族杂环,其中苯基、苄基和杂环基未被取代或者被 1、2 或 3 个相同或不同且选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基和 C₁-C₄ 烷氧基的基团取代。

[0171] 更优选 R^c、R^{2c}、R^k 相互独立地选自氢、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₂-C 链烯基、C₂-C 卤代链烯基、C₂-C 炔基、C₃-C₆ 环烷基、苯基和杂环基,其中杂环基为含有 1、2 或 3 个选自 O、N 和 S 的杂原子作为环成员的 5 或 6 员单环饱和、部分不饱和或芳族杂环。

[0172] R^c、R^{2c}、R^k 尤其相互独立地选自 C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₃-C₆ 环烷基、苯基和杂环基,其中杂环基为具有 1 或 2 个氮原子作为环成员的 5 或 6 员芳族杂环基团。

[0173] R^d、R^{2d} 相互独立地选自 C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基、C₃-C₇ 环烷基,其未被取代或者部分或完全被卤代, C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 卤代链烯基、C₂-C₆ 炔基、C₂-C₆ 卤代炔基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、苯基和苄基。

[0174] 更优选 R^d、R^{2d} 相互独立地选自 C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基、C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 卤代链烯基、C₂-C₆ 炔基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基和 C₃-C₇ 环烷基,其未被取代或者部分或完全被卤代,尤其选自 C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₂-C₄ 卤代炔基和 C₃-C₆ 环烷基。

[0175] R^e、R^f、R^{2e}、R^{2f} 相互独立地选自氢、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基、C₃-C₇ 环烷基,其未被取代或者部分或完全被卤代, C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 卤代链烯基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、苯基和苄基,其中苯基和苄基未被取代或者被 1、2 或 3 个相同或不同且选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基和 C₁-C₄ 烷氧基的基团取代,或者 R^e 和 R^f 或 R^{2e} 和 R^{2f} 与它们所键合的氮原子一起可以形成可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员且未被取代或者可以带有 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基和 C₁-C₄ 烷氧基的基团的 5、6 或 7 员饱和或不饱和 N- 键合杂环基团。

[0176] 更优选 R^e 、 R^f 、 R^{2e} 、 R^{2f} 相互独立地选自氢、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基和苄基, 或 R^e 和 R^f 或 R^{2e} 和 R^{2f} 与它们所键合的氮原子一起形成可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员且未被取代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同且选自卤素、 C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 卤代烷基的基团的 5 或 6 员饱和或不饱和 N- 键合杂环基团。

[0177] R^e 、 R^f 、 R^{2e} 、 R^{2f} 尤其相互独立地选自氢和 C_1 - C_4 烷基, 或者 R^e 和 R^f 或 R^{2e} 和 R^{2f} 与它们所键合的氮原子一起可以形成可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员且可以带有 1、2 或 3 个甲基的 5 或 6 员饱和 N- 键合杂环基团。

[0178] R^g 、 R^{2g} 相互独立地选自氢、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 卤代炔基、 C_3 - C_7 环烷基, 其未被取代或者部分或完全被卤代, C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷基、苄基和苄基; 更优选 R^g 、 R^{2g} 相互独立地选自氢、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷基和 C_3 - C_7 环烷基, 其未被取代或者部分或完全被卤代, 尤其选自 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_2 - C_4 链烯基、 C_2 - C_4 卤代链烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_2 - C_4 卤代炔基和 C_3 - C_6 环烷基。

[0179] R^h 、 R^{2h} 相互独立地选自氢、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_7 环烷基, 其未被取代或者部分或完全被卤代, C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 卤代炔基、 C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷基、苄基、苄基和基团 $C(=O)-R^k$, 其中 R^k 为 H、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基或苄基; 更优选 R^h 、 R^{2h} 相互独立地选自 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷基和 C_3 - C_7 环烷基, 其未被取代或者部分或完全被卤代, 尤其选自 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_2 - C_4 链烯基、 C_2 - C_4 卤代链烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_2 - C_4 卤代炔基和 C_3 - C_6 环烷基, 或者 R^g 和 R^h 或 R^{2g} 和 R^{2h} 与它们所键合的氮原子一起可以形成可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员且未被取代或者可以带有 1、2、3 或 4 个相同或不同且选自 = O、卤素、 C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 卤代烷基和 C_1 - C_4 烷氧基的基团的 5、6 或 7 员饱和或不饱和 N- 键合杂环基团; 更优选 R^g 和 R^h 或 R^{2g} 和 R^{2h} 与它们所键合的氮原子一起形成可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员且未被取代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同且选自卤素、 C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 卤代烷基的基团的 5 或 6 员饱和或不饱和 N- 键合杂环基团, R^g 和 R^h 或 R^{2g} 和 R^{2h} 尤其与它们所键合的氮原子一起可以形成可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员且未被取代或者可以带有 1、2 或 3 个甲基的 5 或 6 员饱和 N- 键合杂环基团。

[0180] n 优选为 0。

[0181] k 优选为 0 或 2。

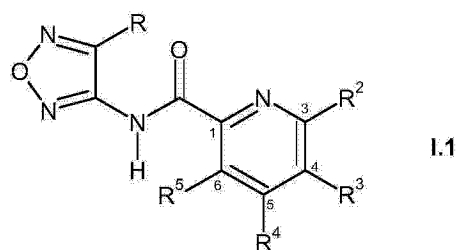
[0182] R^q 优选为卤素、OH、 NO_2 、氰基、氧代 ($=O$)、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_2 - C_4 链烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 卤代烷硫基和 C_1 - C_4 卤代烷氧基。

[0183] 具有优选其中 X^1 、 X^2 和 X^4 中的一个为 N 的式 I 化合物。

[0184] 同样具体优选其中 X^1 、 X^2 和 X^4 中的两个为 N 的式 I 化合物。

[0185] 本发明的特别优选实施方案涉及其中 X^1 为 N, X^2 为 CR^2 且 X^4 为 CR^4 的式 I 化合物。这些化合物也称为式 I. 1 化合物, 其中 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R 如上面对式 I 化合物所定义:

[0186]



[0187] 熟练技术人员易于理解就式 I 化合物而言对 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R 所给优选情形也适用于本文所定义的式 I. 1。在式 I. 1 中，吡啶环上的位置由阿拉伯数字表示。

[0188] 在式 I. 1 中，优选其中 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R 具有上述优选含义的那些。尤其优选如下式 I. 1 化合物，其中 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R 具有上述优选含义且变量 R^2 选自氢、 C_1 - C_2 烷氧基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷氧基、 C_1 - C_2 烷基、 $S(O)_2$ - C_1 - C_4 烷基、异噁唑基和异噁唑啉基，其中后提到的 2 个基团可以被取代或者带有 1 或 2 个选自卤素和 C_1 - C_4 烷基的基团。 R^2 尤其选自氢、甲氧基甲基、乙氧基甲基、2, 2, 2-三氟乙氧基甲基、2, 2, 2-三氟乙氧基乙基、甲基磺酰基、4, 5-二氢异噁唑-5-基、4, 5-二氢异噁唑-3-基、3-甲基-4, 5-二氢异噁唑-5-基、5-甲基-4, 5-二氢异噁唑-3-基、异噁唑-5-基、3-甲基-异噁唑-5-基、异噁唑-3-基和 5-甲基异噁唑-3-基。

[0189] 在本发明的该特别优选实施方案中，基团 R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^5 一起形成例如在化合物 I. 1 的吡啶环上的下列取代方式之一，条件是位置 1 为该吡啶环与该分子的其余部分的连接点：4, 6- Cl_2 、4-CN-6-Cl、4-F-6-Cl、4- CF_3 -6-Cl、4- $S(O)_2CH_3$ -6-Cl、4-CN-6-F、4- CF_3 -6-F、4- $S(O)_2CH_3$ -6-F、4-Cl-6-F、4, 6- F_2 、6-Cl、6-F、6- CF_3 、6- CH_3 、6- CHF_2 、3-(3-异噁唑啉基)-4-CN-6-Cl、3-(3-异噁唑啉基)-4, 6- Cl_2 、3-(3-异噁唑啉基)-4-F-6-Cl、3-(3-异噁唑啉基)-4- CF_3 -6-Cl、3-(3-异噁唑啉基)-4- $S(O)_2CH_3$ -6-Cl、3-(3-异噁唑啉基)-4, 6- Cl_2 、3-(3-异噁唑啉基)-4-CN-6-F、3-(3-异噁唑啉基)-4- CF_3 -6-F、3-(3-异噁唑啉基)-4- $S(O)_2CH_3$ -6-F、3-(3-异噁唑啉基)-4-Cl-6-F、3-(3-异噁唑啉基)-4, 6- F_2 、3-(3-异噁唑啉基)-6-Cl、3-(3-异噁唑啉基)-6-F、3-(CH_2 -O- CH_2CF_3)-4-CN-6-Cl、3-(CH_2 -O- CH_2CF_3)-4, 6- Cl_2 、3-(CH_2 -O- CH_2CF_3)-4- CF_3 -6-Cl、3-(CH_2 -O- CH_2CF_3)-4- $S(O)_2CH_3$ -6-Cl、3-(CH_2 -O- CH_2CF_3)-4-F-6-Cl、3-(CH_2 -O- CH_2CF_3)-4-CN-6-F、3-(CH_2 -O- CH_2CF_3)-4- CF_3 -6-F、3-(CH_2 -O- CH_2CF_3)-4- $S(O)_2CH_3$ -6-F、3-(CH_2 -O- CH_2CF_3)-4-Cl-6-F、3-(CH_2 -O- CH_2CF_3)-4, 6- F_2 、3-(CH_2 -O- CH_2CF_3)-6-Cl、3-(CH_2 -O- CH_2CF_3)-6-F、3-(3-异噁唑啉基)-6-Cl、3-(3-异噁唑啉基)-6-F、3-(3-异噁唑啉基)-6- CF_3 、3-(3-异噁唑啉基)-6- CH_3 、3-(3-异噁唑啉基)-6- CHF_2 、3-(CH_2 -O- CH_2CF_3)-6-Cl、3-(CH_2 -O- CH_2CF_3)-6-F、3-(CH_2 -O- CH_2CF_3)-6- CF_3 、3-(CH_2 -O- CH_2CF_3)-6- CH_3 、3-(CH_2 -O- CH_2CF_3)-6- CHF_2 。

[0190] 更优选如下式 I. 1 化合物，其中变量 R、 R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^5 具有下列含义：

[0191] R 为 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 烷氧基,尤其是甲基、乙基、甲氧基或乙氧基;

[0192] R^2 选自氢、 C_1-C_2 烷氧基- C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 卤代烷氧基- C_1-C_2 烷基、 $S(O)_2-C_1-C_4$ 烷基、异噁唑基和异噁唑啉基,其中后提到的 2 个基团可以被取代或者带有 1 或 2 个选自卤素和 C_1-C_4 烷基的基团,尤其是氢、甲氧基甲基、乙氧基甲基、2,2,2-三氟乙氧基甲基、2,2,2-三氟乙氧基乙基、甲基磺酰基、4,5-二氢异噁唑-5-基、4,5-二氢异噁唑-3-基、3-甲基-4,5-二氢异噁唑-5-基、5-甲基-4,5-二氢异噁唑-3-基、异噁唑-5-基、3-甲基异噁唑-5-基、异噁唑-3-基和 5-甲基异噁唑-3-基;

[0193] R^3 选自氢、卤素、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷硫基和 C_1-C_4 烷基磺酰基,尤其是 Cl、F、 CF_3 、 SO_2CH_3 或 CN;

[0194] R^4 选自氢、卤素、氰基、硝基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 卤代烷基,尤其是氢、 CHF_2 、 CF_3 、 CH_3 、 NO_2 和卤素;以及

[0195] R^5 选自氢、氰基、卤素、硝基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 卤代烷基,尤其是氢、卤素、 CH_3 、 CHF_2 和 CF_3 。

[0196] 甚至更优选如下式 I. 1 化合物,其中变量 R、 R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^5 具有下列含义:

[0197] R 选自 C_1-C_4 烷基和 C_1-C_4 烷氧基;

[0198] R^2 选自氢、 C_1-C_2 烷氧基- C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 卤代烷氧基- C_1-C_2 烷基、 $S(O)_2-C_1-C_4$ 烷基、异噁唑基和异噁唑啉基,其中后提到的 2 个基团可以被取代或者带有 1 或 2 个选自卤素和 C_1-C_4 烷基的基团;

[0199] R^3 选自氢、卤素、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷硫基和 C_1-C_4 烷基磺酰基;

[0200] R^4 选自氢、CN、 CHF_2 、 CF_3 、 CH_3 、 NO_2 和卤素;以及

[0201] R^5 选自氢、卤素、 CH_3 、 CHF_2 和 CF_3 。

[0202] 考虑到它们的用途,特别优选汇编在下表 1-11 中的式 I. 1 化合物。此外,对表中取代基所提到的基团本身为所述取代基的特别优选实施方案,与其中提到它们的组合无关。

[0203] 表 1

[0204] 其中 R^2 为氢且 R、 R^3 、 R^4 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 A 的一行的式 I. 1 化合物(化合物 I. 1-1 至 I. 1-150);

[0205] 表 2

[0206] 其中 R^2 为 SO_2CH_3 且 R、 R^3 、 R^4 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 A 的一行的式 I. 1 化合物(化合物 I. 1-151 至 I. 1-300);

[0207] 表 3

[0208] 其中 R^2 为 2,2,2-三氟乙氧基甲基且 R、 R^3 、 R^4 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 A 的一行的式 I. 1 化合物(化合物 I. 1-301 至 I. 1-450);

[0209] 表 4

[0210] 其中 R^2 为 4,5-二氢异噁唑-3-基且 R、 R^3 、 R^4 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 A 的一行的式 I. 1 化合物(化合物 I. 1-451 至 I. 1-600);

[0211] 表 5

[0212] 其中 R^2 为 5- 甲基 -4, 5- 二氢异噁唑 -3- 基且 R 、 R^3 、 R^4 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 A 的一行的式 I. 1 化合物（化合物 I. 1-601 至 I. 1-750）；

[0213] 表 6

[0214] 其中 R^2 为 4, 5- 二氢异噁唑 -5- 基且 R 、 R^3 、 R^4 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 A 的一行的式 I. 1 化合物（化合物 I. 1-751 至 I. 1-900）；

[0215] 表 7

[0216] 其中 R^2 为 3- 甲基 -4, 5- 二氢异噁唑 -5- 基且 R 、 R^3 、 R^4 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 A 的一行的式 I. 1 化合物（化合物 I. 1-901 至 I. 1-1050）；

[0217] 表 8

[0218] 其中 R^2 为异噁唑 -3- 基且 R 、 R^3 、 R^4 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 A 的一行的式 I. 1 化合物（化合物 I. 1-1051 至 I. 1-1200）；

[0219] 表 9

[0220] 其中 R^2 为 5- 甲基异噁唑 -3- 基且 R 、 R^3 、 R^4 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 A 的一行的式 I. 1 化合物（化合物 I. 1-1201 至 I. 1-1350）；

[0221] 表 10

[0222] 其中 R^2 为异噁唑 -5- 基且 R 、 R^3 、 R^4 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 A 的一行的式 I. 1 化合物（化合物 I. 1-1351 至 I. 1-1500）；

[0223] 表 11

[0224] 其中 R^2 为 3- 甲基异噁唑 -5- 基且 R 、 R^3 、 R^4 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 A 的一行的式 I. 1 化合物（化合物 I. 1-1501 至 I. 1-1650）。

[0225] 表 A

[0226]

	R	R ³	R ⁴	R ⁵
A-1	甲基	Cl	H	H
A-2	乙基	Cl	H	H
A-3	甲氧基	Cl	H	H
A-4	甲基	F	H	H
A-5	乙基	F	H	H
A-6	甲氧基	F	H	H
A-7	甲基	CF ₃	H	H
A-8	乙基	CF ₃	H	H
A-9	甲氧基	CF ₃	H	H
A-10	甲基	SO ₂ CH ₃	H	H
A-11	乙基	SO ₂ CH ₃	H	H
A-12	甲氧基	SO ₂ CH ₃	H	H
A-13	甲基	CN	H	H
A-14	乙基	CN	H	H
A-15	甲氧基	CN	H	H
A-16	甲基	Cl	F	H
A-17	乙基	Cl	F	H
A-18	甲氧基	Cl	F	H
A-19	甲基	F	F	H
A-20	乙基	F	F	H
A-21	甲氧基	F	F	H
A-22	甲基	CF ₃	F	H
A-23	乙基	CF ₃	F	H
A-24	甲氧基	CF ₃	F	H
A-25	甲基	SO ₂ CH ₃	F	H
A-26	乙基	SO ₂ CH ₃	F	H

	R	R ³	R ⁴	R ⁵
A-27	甲氧基	SO ₂ CH ₃	F	H
A-28	甲基	CN	F	H
A-29	乙基	CN	F	H
A-30	甲氧基	CN	F	H
A-31	甲基	Cl	Cl	H
A-32	乙基	Cl	Cl	H
A-33	甲氧基	Cl	Cl	H
A-34	甲基	F	Cl	H
A-35	乙基	F	Cl	H
A-36	甲氧基	F	Cl	H
A-37	甲基	CF ₃	Cl	H
A-38	乙基	CF ₃	Cl	H
A-39	甲氧基	CF ₃	Cl	H
A-40	甲基	SO ₂ CH ₃	Cl	H
A-41	乙基	SO ₂ CH ₃	Cl	H
A-42	甲氧基	SO ₂ CH ₃	Cl	H
A-43	甲基	CN	Cl	H
A-44	乙基	CN	Cl	H
A-45	甲氧基	CN	Cl	H
A-46	甲基	Cl	H	F
A-47	乙基	Cl	H	F
A-48	甲氧基	Cl	H	F
A-49	甲基	F	H	F
A-50	乙基	F	H	F
A-51	甲氧基	F	H	F
A-52	甲基	CF ₃	H	F

[0227]

	R	R ³	R ⁴	R ⁵
A-53	乙基	CF ₃	H	F
A-54	甲氧基	CF ₃	H	F
A-55	甲基	SO ₂ CH ₃	H	F
A-56	乙基	SO ₂ CH ₃	H	F
A-57	甲氧基	SO ₂ CH ₃	H	F
A-58	甲基	CN	H	F
A-59	乙基	CN	H	F
A-60	甲氧基	CN	H	F
A-61	甲基	Cl	F	F
A-62	乙基	Cl	F	F
A-63	甲氧基	Cl	F	F
A-64	甲基	F	F	F
A-65	乙基	F	F	F
A-66	甲氧基	F	F	F
A-67	甲基	CF ₃	F	F
A-68	乙基	CF ₃	F	F
A-69	甲氧基	CF ₃	F	F
A-70	甲基	SO ₂ CH ₃	F	F
A-71	乙基	SO ₂ CH ₃	F	F
A-72	甲氧基	SO ₂ CH ₃	F	F
A-73	甲基	CN	F	F
A-74	乙基	CN	F	F
A-75	甲氧基	CN	F	F
A-76	甲基	Cl	Cl	F
A-77	乙基	Cl	Cl	F
A-78	甲氧基	Cl	Cl	F
A-79	甲基	F	Cl	F
A-80	乙基	F	Cl	F
A-81	甲氧基	F	Cl	F
A-82	甲基	CF ₃	Cl	F
A-83	乙基	CF ₃	Cl	F
A-84	甲氧基	CF ₃	Cl	F
A-85	甲基	SO ₂ CH ₃	Cl	F
A-86	乙基	SO ₂ CH ₃	Cl	F
A-87	甲氧基	SO ₂ CH ₃	Cl	F
A-88	甲基	CN	Cl	F
A-89	乙基	CN	Cl	F
A-90	甲氧基	CN	Cl	F
A-91	甲基	Cl	H	Cl
A-92	乙基	Cl	H	Cl
A-93	甲氧基	Cl	H	Cl
A-94	甲基	F	H	Cl

	R	R ³	R ⁴	R ⁵
A-95	乙基	F	H	Cl
A-96	甲氧基	F	H	Cl
A-97	甲基	CF ₃	H	Cl
A-98	乙基	CF ₃	H	Cl
A-99	甲氧基	CF ₃	H	Cl
A-100	甲基	SO ₂ CH ₃	H	Cl
A-101	乙基	SO ₂ CH ₃	H	Cl
A-102	甲氧基	SO ₂ CH ₃	H	Cl
A-103	甲基	CN	H	Cl
A-104	乙基	CN	H	Cl
A-105	甲氧基	CN	H	Cl
A-106	甲基	Cl	F	Cl
A-107	乙基	Cl	F	Cl
A-108	甲氧基	Cl	F	Cl
A-109	甲基	F	F	Cl
A-110	乙基	F	F	Cl
A-111	甲氧基	F	F	Cl
A-112	甲基	CF ₃	F	Cl
A-113	乙基	CF ₃	F	Cl
A-114	甲氧基	CF ₃	F	Cl
A-115	甲基	SO ₂ CH ₃	F	Cl
A-116	乙基	SO ₂ CH ₃	F	Cl
A-117	甲氧基	SO ₂ CH ₃	F	Cl
A-118	甲基	CN	F	Cl
A-119	乙基	CN	F	Cl
A-120	甲氧基	CN	F	Cl
A-121	甲基	Cl	Cl	Cl
A-122	乙基	Cl	Cl	Cl
A-123	甲氧基	Cl	Cl	Cl
A-124	甲基	F	Cl	Cl
A-125	乙基	F	Cl	Cl
A-126	甲氧基	F	Cl	Cl
A-127	甲基	CF ₃	Cl	Cl
A-128	乙基	CF ₃	Cl	Cl
A-129	甲氧基	CF ₃	Cl	Cl
A-130	甲基	SO ₂ CH ₃	Cl	Cl
A-131	乙基	SO ₂ CH ₃	Cl	Cl
A-132	甲氧基	SO ₂ CH ₃	Cl	Cl
A-133	甲基	CN	Cl	Cl
A-134	乙基	CN	Cl	Cl
A-135	甲氧基	CN	Cl	Cl
A-136	甲基	Cl	H	CF ₃

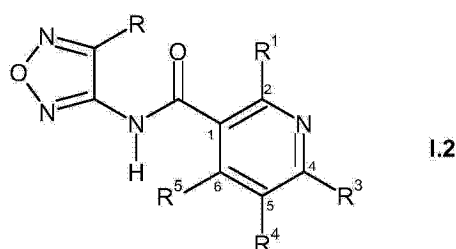
[0228]

	R	R ³	R ⁴	R ⁵
A-137	乙基	Cl	H	CF ₃
A-138	甲氧基	Cl	H	CF ₃
A-139	甲基	F	H	CF ₃
A-140	乙基	F	H	CF ₃
A-141	甲氧基	F	H	CF ₃
A-142	甲基	CF ₃	H	CF ₃
A-143	乙基	CF ₃	H	CF ₃

	R	R ³	R ⁴	R ⁵
A-144	甲氧基	CF ₃	H	CF ₃
A-145	甲基	SO ₂ CH ₃	H	CF ₃
A-146	乙基	SO ₂ CH ₃	H	CF ₃
A-147	甲氧基	SO ₂ CH ₃	H	CF ₃
A-148	甲基	CN	H	CF ₃
A-149	乙基	CN	H	CF ₃
A-150	甲氧基	CN	H	CF ₃

[0229] 本发明的进一步特别优选实施方案涉及,其中 X¹ 为 C-R¹, X² 为 N 且 X⁴ 为 CR⁴ 的式 I 化合物。这些化合物也称为式 I.2 化合物,其中 R¹、R³、R⁴、R⁵ 和 R 如上文对式 I 化合物所定义:

[0230]



[0231] 熟练技术人员易于理解就式 I 化合物而言对 R¹、R³、R⁴、R⁵ 和 R 所给优选情形也适用于本文所定义的式 I.2。在式 I.2 中,吡啶环上的位置由阿拉伯数字表示。

[0232] 在式 I.2 化合物中,优选其中 R¹、R³、R⁴、R⁵ 和 R 具有上述优选含义的那些。更优选如下式 I.2 化合物,其中 R³、R⁴、R⁵ 和 R 具有优选含义且变量 R¹ 为卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷氧基-C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基-C₁-C₄ 烷氧基-C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基磺基、C₁-C₄ 卤代烷基磺基或 C₁-C₄ 烷基磺酰基,尤其是 F、Cl、Br、CH₃、CF₃、CH₂OCH₂CH₂OCH₃、OCH₃、OCF₃、OCHF₂、SCF₃、SCHF₂ 或 SO₂CH₃。

[0233] 在本发明的该特别优选实施方案中,基团 R¹、R³、R⁴ 和 R⁵ 一起形成例如在化合物 I.2 的吡啶环上的下列取代方式之一,条件是位置 1 为该吡啶环与该分子的其余部分的连接点:2-Br、2-Cl、2-CF₃、2-CH₃、2-S(O)₂CH₃、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-CN、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-Cl、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-CF₃、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-S(O)₂CH₃、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-F、2-Br-4-Cl、2-Cl-4-CN、2,4-Cl₂、2-Cl-4-F、2-Cl-4-CF₃、2-Cl-4-S(O)₂CH₃、2-CF₃-4-CN、2-CF₃-4-Cl、2-CF₃-4-CF₃、2-CF₃-4-S(O)₂CH₃、2-CF₃-4-F、2-CH₃-4-CN、2-CH₃-4-Cl、2-CH₃-4-CF₃、2-CH₃-4-S(O)₂CH₃、2-CH₃-4-F、2-S(O)₂CH₃-4-CN、2-S(O)₂CH₃-4-Cl、2-S(O)₂CH₃-4-CF₃、2-S(O)₂CH₃-4-S(O)₂CH₃、2-S(O)₂CH₃-4-F、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-6-Cl、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-6-F、2-Br-6-Cl、2,6-Cl₂、2-Cl-6-F、2-CF₃-6-Cl、2-CF₃-6-F、2-CH₃-6-Cl、2-CH₃-6-F、2-S(O)₂CH₃-6-Cl、2-S(O)₂CH₃-6-F、2-Br-4,6-Cl₂、2,4,6-Cl₃、2,6-Cl₂-4-F、2,6-Cl₂-4-CF₃、2,6-Cl₂-4-S(O)₂CH₃、2-CF₃-4-CN-6-Cl、2-CF₃-4,6-Cl₂、2-CF₃-4-CF₃-6-Cl、2-CF₃-4-S(O)₂CH₃-6-Cl、2-CF₃-4-F-6-Cl、2-CH₃-4-CN-6-Cl、2-CH₃-4,6-Cl₂、2-CH₃-4-CF₃-6-Cl、2-CH₃-4-S(O)₂CH₃-6-Cl、2-CH₃-4-F-6-Cl、2-S(O)₂CH₃-4-CN-6-Cl、2-S(O)₂CH₃-4,6-Cl₂、2-S(O)₂CH₃-4-CF₃-6-Cl、

2-S(O)₂CH₃-4-S(O)₂CH₃-6-Cl、2-S(O)₂CH₃-4-F-6-Cl、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-CN-6-Cl、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4, 6-Cl₂、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-CF₃-6-Cl、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-S(O)₂CH₃-6-Cl、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-F-6-Cl、2-Cl-4-CN-6-F、2-Cl-4-CF₃-6-F、2-Cl-4-S(O)₂CH₃-6-F、2, 4-Cl₂-6-F、2-Cl-4, 6-F₂、2-CF₃-4-CN-6-F、2-CF₃-4-CF₃-6-F、2-CF₃-4-S(O)₂CH₃-6-F、2-CF₃-4-Cl-6-F、2-CF₃-4, 6-F₂、2-CH₃-4-CN-6-F、2-CH₃-4-CF₃-6-F、2-CH₃-4-S(O)₂CH₃-6-F、2-CH₃-4-Cl-6-F、2-CH₃-4, 6-F₂、2-S(O)₂CH₃-4-CN-6-F、2-S(O)₂CH₃-4-CF₃-6-F、2-S(O)₂CH₃-4-S(O)₂CH₃-6-F、2-S(O)₂CH₃-4-Cl-6-F、2-S(O)₂CH₃-4, 6-F₂、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-CN-6-F、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-Cl-6-F、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-CF₃-6-F、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-S(O)₂CH₃-6-F、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4, 6-F₂。

[0234] 更优选如下式 I. 2 化合物, 其中变量 R、R¹、R³、R⁴ 和 R⁵ 具有下列含义:

[0235] R 为 C₁-C₄ 烷基或 C₁-C₄ 烷氧基, 尤其是甲基、乙基、甲氧基或乙氧基;

[0236] R¹ 为卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基-C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基-C₁-C₄ 烷氧基-C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₄ 卤代烷硫基或 C₁-C₄ 烷基磺酰基, 尤其是 F、Cl、Br、CH₃、CF₃、OCH₃、OCF₃、OCHF₂、SCF₃、SCHF₂、SO₂CH₃ 或 CH₂OCH₂CH₂OCH₃;

[0237] R³ 选自氢、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷硫基和 C₁-C₄ 烷基磺酰基, 尤其是 Cl、F、CF₃、SO₂CH₃ 或 CN;

[0238] R⁴ 选自氢、卤素、氰基、硝基、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 卤代烷基, 尤其是氢、CHF₂、CF₃、CH₃、NO₂; 以及

[0239] R⁵ 选自氢、氰基、卤素、硝基、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 卤代烷基, 尤其是氢、卤素、CHF₂ 和 CF₃。

[0240] 甚至更优选如下式 I. 2 化合物, 其中变量 R、R¹、R³、R⁴ 和 R⁵ 具有下列含义:

[0241] R 选自 C₁-C₄ 烷基和 C₁-C₄ 烷氧基;

[0242] R¹ 为卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基-C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基-C₁-C₄ 烷氧基-C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₄ 卤代烷硫基或 C₁-C₄ 烷基磺酰基;

[0243] R³ 选自氢、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷硫基和 C₁-C₄ 烷基磺酰基;

[0244] R⁴ 选自氢、CN、CHF₂、CF₃、CH₃、NO₂ 和卤素; 以及

[0245] R⁵ 选自氢、卤素、CHF₂ 和 CF₃。

[0246] 考虑到它们的用途, 特别优选汇编在下表 12-15 中的式 I. 2 化合物。此外, 对表中取代基所提到的基团本身为所述取代基的特别优选实施方案, 与其中提到它们的组合无关。

[0247] 表 12

[0248] 其中 R¹ 为氯且 R、R³、R⁴ 和 R⁵ 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 A 的一行的式 I. 2 化合物 (化合物 I. 2-1 至 I. 2-150);

[0249] 表 13

[0250] 其中 R¹ 为甲基且 R、R³、R⁴ 和 R⁵ 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 A 的一行的式 I. 2 化合物 (化合物 I. 2-151 至 I. 2-300);

[0251] 表 14

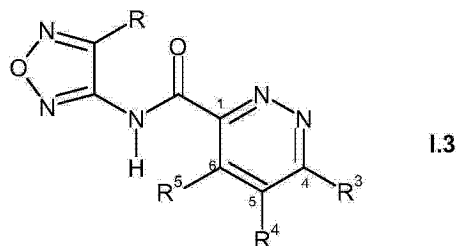
[0252] 其中 R^1 为三氟甲基且 R 、 R^3 、 R^4 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 A 的一行的式 I. 2 化合物（化合物 I. 2-301 至 I. 2-450）；

[0253] 表 15

[0254] 其中 R^1 为甲基磺酰基且 R 、 R^3 、 R^4 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 A 的一行的式 I. 2 化合物（化合物 I. 2-451 至 I. 2-600）。

[0255] 本发明的进一步特别优选实施方案涉及其中的式 I 化合物 X^1 为 N, X^2 为 N 且 X^4 为 CR^4 。这些化合物称为式 I. 3 化合物, 其中 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R 如上文对式 I 化合物所定义：

[0256]



[0257] 熟练技术人员易于理解就式 I 化合物而言对 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R 所给优选情形也适用于本文所定义的式 I. 3。在式 I. 3 中, 哒嗪环上的位置由阿拉伯数字表示。

[0258] 在式 I. 3 化合物中, 优选其中变量 R 、 R^3 、 R^4 和 R^5 具有下列含义的那些：

[0259] R 选自 C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 烷氧基, 尤其是甲基、乙基、甲氧基或乙氧基；

[0260] R^3 选自氢、卤素、CN、 NO_2 、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷硫基和 C_1 - C_4 烷基磺酰基, 尤其是 H、F、Cl、Br、CN、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 CF_3 、 CHF_2 、 OCH_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 SO_2CH_3 或 $SO_2CH_2CH_3$ ；

[0261] R^4 选自氢、卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 卤代烷基, 尤其是氢、 CHF_2 、 CF_3 、 CH_3 、 NO_2 和卤素；以及

[0262] R^5 选自氢、氰基、卤素、硝基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 卤代烷基, 尤其是氢、卤素、 CH_3 、 CHF_2 和 CF_3 。

[0263] 在本发明的该特别优选实施方案中, 基团 R^3 、 R^4 和 R^5 一起形成例如在化合物 I. 3 的哒嗪环上的下列取代方式之一, 条件是位置 1 为该哒嗪环与该分子的其余部分的连接点：4, 6- Cl_2 、4-CN-6-Cl、4- CF_3 -6-Cl、4-S(O) $_2$ CH $_3$ -6-Cl、4-F-6-Cl、4-CN-6-F、4- CF_3 -6-F、4-S(O) $_2$ CH $_3$ -6-F、4-Cl-6-F、4, 6-F $_2$ 、4-Cl-6- CF_3 、4-CN-6- CF_3 、4- CF_3 -6- CF_3 、4-S(O) $_2$ CH $_3$ -6- CF_3 、4-F-6- CF_3 、4-Cl-6- CH_3 、4-CN-6- CH_3 、4- CF_3 -6- CH_3 、4-S(O) $_2$ CH $_3$ -6- CH_3 、4-F-6- CH_3 、4-Cl-6- CHF_2 、4-CN-6- CHF_2 、4- CF_3 -6- CHF_2 、4-S(O) $_2$ CH $_3$ -6- CHF_2 、4-F-6- CHF_2 、6-Cl、6-F、6- CF_3 、6- CHF_2 、6- CH_3 。

[0264] 更优选如下式 I. 3 化合物, 其中变量 R 、 R^3 、 R^4 和 R^5 具有下列含义：

[0265] R 选自 C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 烷氧基；

[0266] R^3 选自氢、卤素、CN、 NO_2 、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷硫基和 C_1 - C_4 烷基磺酰基；

[0267] R^4 选自氢、CN、 CHF_2 、 CF_3 、 CH_3 、 NO_2 和卤素；以及

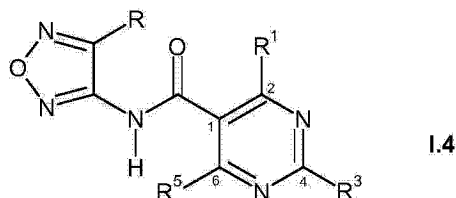
[0268] R^5 选自氢、卤素、 CH_3 、 CHF_2 和 CF_3 。

[0269] 考虑到它们的用途, 特别优选汇编在上表 A 中的式 I. 3 化合物（化合物 I. 3-1 至

I. 3-150)。在表 A 中, R^3 、 R^4 和 R^5 一起在每种情况下具有表 A 的一行所给含义。此外, 对表 A 中取代基所提到的基团本身为所述取代基的特别优选实施方案, 与其中提到它们的组合无关。

[0270] 本发明的进一步特别优选实施方案涉及其中 X^1 为 C- R^1 , X^2 为 N 且 X^4 为 N 的式 I 化合物。该化合物也称为式 I. 4 化合物, 其中 R^1 、 R^3 、 R^5 和 R 如上文对式 I 化合物所定义:

[0271]



[0272] 熟练技术人员易于理解就式 I 化合物而言对 R^1 、 R^3 、 R^5 和 R 所给优选情形也适用于本文所定义的式 I. 4。在式 I. 4 中, 嘧啶环上的位置由阿拉伯数字表示。

[0273] 在式 I. 4 化合物中, 优选如下那些, 其中 R^3 、 R^5 和 R 具有优选含义且变量 R^1 选自卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 卤代烷硫基和 C_1 - C_4 烷基磺酰基, 尤其选自 F、Cl、Br、 CH_3 、 CF_3 、 OCH_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 SCF_3 、 $SCHF_2$ 、 SO_2CH_3 和 $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ 。

[0274] 在本发明的该特别优选实施方案中, 基团 R^1 、 R^3 和 R^5 一起形成例如在化合物 I. 4 的嘧啶环上的下列取代方式之一, 条件是位置 1 为该嘧啶环与该分子的其余部分的连接点: 2-Br、2-Cl、2- CF_3 、2- CH_3 、2-S(O) $_2$ CH $_3$ 、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ 、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -4-CN、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -4-Cl、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -4- CF_3 、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -4-S(O) $_2$ CH $_3$ 、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -4-F、2-Br-4-Cl、2-Cl-4-CN、2, 4-Cl $_2$ 、2-Cl-4-F、2-Cl-4- CF_3 、2-Cl-4-S(O) $_2$ CH $_3$ 、2- CF_3 -4-CN、2- CF_3 -4-Cl、2- CF_3 -4- CF_3 、2- CF_3 -4-S(O) $_2$ CH $_3$ 、2- CF_3 -4-F、2- CH_3 -4-CN、2- CH_3 -4-Cl、2- CH_3 -4- CF_3 、2- CH_3 -4-S(O) $_2$ CH $_3$ 、2- CH_3 -4-F、2-S(O) $_2$ CH $_3$ -4-CN、2-S(O) $_2$ CH $_3$ -4-Cl、2-S(O) $_2$ CH $_3$ -4- CF_3 、2-S(O) $_2$ CH $_3$ -4-S(O) $_2$ CH $_3$ 、2-S(O) $_2$ CH $_3$ -4-F、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -6-Cl、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -6-F、2-Br-6-Cl、2, 6-Cl $_2$ 、2-Cl-6-F、2- CF_3 -6-Cl、2- CF_3 -6-F、2- CH_3 -6-Cl、2- CH_3 -6-F、2-S(O) $_2$ CH $_3$ -6-Cl、2-S(O) $_2$ CH $_3$ -6-F、2-Br-4, 6-Cl $_2$ 、2, 6-Cl $_2$ -4-CN、2, 4, 6-Cl $_3$ 、2, 6-Cl $_2$ -4-F、2, 6-Cl $_2$ -4- CF_3 、2, 6-Cl $_2$ -4-S(O) $_2$ CH $_3$ 、2- CF_3 -4-CN-6-Cl、2- CF_3 -4, 6-Cl $_2$ 、2- CF_3 -4- CF_3 -6-Cl、2- CF_3 -4-S(O) $_2$ CH $_3$ -6-Cl、2- CF_3 -4-F-6-Cl、2- CH_3 -4-CN-6-Cl、2- CH_3 -4, 6-Cl $_2$ 、2- CH_3 -4- CF_3 -6-Cl、2- CH_3 -4-S(O) $_2$ CH $_3$ -6-Cl、2- CH_3 -4-F-6-Cl、2-S(O) $_2$ CH $_3$ -4-CN-6-Cl、2-S(O) $_2$ CH $_3$ -4, 6-Cl $_2$ 、2-S(O) $_2$ CH $_3$ -4- CF_3 -6-Cl、2-S(O) $_2$ CH $_3$ -4-S(O) $_2$ CH $_3$ -6-Cl、2-S(O) $_2$ CH $_3$ -4-F-6-Cl、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -4-CN-6-Cl、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -4, 6-Cl $_2$ 、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -4- CF_3 -6-Cl、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -4-S(O) $_2$ CH $_3$ -6-Cl、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -4-F-6-Cl、2-Cl-4-CN-6-F、2-Cl-4- CF_3 -6-F、2-Cl-4-S(O) $_2$ CH $_3$ -6-F、2, 4-Cl $_2$ -6-F、2-Cl-4, 6-F $_2$ 、2- CF_3 -4-CN-6-F、2- CF_3 -4- CF_3 -6-F、2- CF_3 -4-S(O) $_2$ CH $_3$ -6-F、2- CF_3 -4-Cl-6-F、2- CF_3 -4, 6-F $_2$ 、2- CH_3 -4-CN-6-F、2- CH_3 -4- CF_3 -6-F、2- CH_3 -4-S(O) $_2$ CH $_3$ -6-F、2- CH_3 -4-Cl-6-F、2- CH_3 -4, 6-F $_2$ 、2-S(O) $_2$ CH $_3$ -4-CN-6-F、2-S(O) $_2$ CH $_3$ -4- CF_3 -6-F、2-S(O) $_2$ CH $_3$ -4-S(O) $_2$ CH $_3$ -6-F、2-S(O) $_2$ CH $_3$ -4-Cl-6-F、2-S(O) $_2$ CH $_3$ -4, 6-F $_2$ 、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -4-CN-6-F、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -4-Cl-6-F、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -4- CF_3 -6-F、

2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-S(O)₂CH₃-6-F、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4,6-F₂。

[0275] 更优选如下式 I. 4 化合物, 其中变量 R、R¹、R³ 和 R⁵ 具有下列含义:

[0276] R 为 C₁-C₄ 烷基或 C₁-C₄ 烷氧基, 尤其是甲基、乙基、甲氧基或乙氧基;

[0277] R¹ 为卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₄ 卤代烷硫基或 C₁-C₄ 烷基磺酰基, 尤其是 F、Cl、Br、I、CH₃、CF₃、OCH₃、OCF₃、OCHF₂、CH₂OCH₂CH₂OCH₃、SCF₃、SCHF₂ 或 SO₂CH₃;

[0278] R³ 为氢、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷硫基和 C₁-C₄ 烷基磺酰基, 尤其是 H、F、Cl、Br、CN、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、CF₃、CHF₂、OCH₃、OCF₃、OCHF₂、SCH₃、SO₂CH₃ 或 SO₂CH₂CH₃; 以及

[0279] R⁵ 选自氢、氰基、卤素、硝基、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 卤代烷基, 尤其是氢、卤素、CHF₂ 和 CF₃。

[0280] 甚至更优选如下式 I. 4 化合物, 其中变量 R、R¹、R³ 和 R⁵ 具有下列含义:

[0281] R 为 C₁-C₄ 烷基或 C₁-C₄ 烷氧基;

[0282] R¹ 为卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₄ 卤代烷硫基或 C₁-C₄ 烷基磺酰基;

[0283] R³ 选自氢、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷硫基和 C₁-C₄ 烷基磺酰基; 以及

[0284] R⁵ 选自氢、卤素、CHF₂ 和 CF₃。

[0285] 考虑到它们的用途, 特别优选汇编在下表 16-19 中的式 I. 4 化合物。此外, 对表中取代基所提到的基团本身为所述取代基的特别优选实施方案, 与其中提到它们的组合无关。

[0286] 表 16

[0287] 其中 R¹ 为氯且 R、R³ 和 R⁵ 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 Aa 的一行的式 I. 4 化合物 (化合物 I. 4-1 至 I. 4-66);

[0288] 表 17

[0289] 其中 R¹ 为甲基且 R、R³ 和 R⁵ 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 Aa 的一行的式 I. 4 化合物 (化合物 I. 4-67 至 I. 4-132);

[0290] 表 18

[0291] 其中 R¹ 为三氟甲基且 R、R³ 和 R⁵ 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 Aa 的一行的式 I. 4 化合物 (化合物 I. 4-133 至 I. 4-198);

[0292] 表 19

[0293] 其中 R¹ 为甲基磺酰基且 R、R³ 和 R⁵ 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 Aa 的一行的式 I. 4 化合物 (化合物 I. 4-199 至 I. 4-264)。

[0294] 表 Aa

[0295]

	R	R ³	R ⁵
Aa-1	甲基	Cl	H
Aa-2	乙基	Cl	H
Aa-3	甲氧基	Cl	H
Aa-4	甲基	F	H
Aa-5	乙基	F	H
Aa-6	甲氧基	F	H
Aa-7	甲基	CF ₃	H
Aa-8	乙基	CF ₃	H
Aa-9	甲氧基	CF ₃	H
Aa-10	甲基	SO ₂ CH ₃	H
Aa-11	乙基	SO ₂ CH ₃	H
Aa-12	甲氧基	SO ₂ CH ₃	H
Aa-13	甲基	CN	H
Aa-14	乙基	CN	H
Aa-15	甲氧基	CN	H
Aa-16	甲基	Cl	F
Aa-17	乙基	Cl	F
Aa-18	甲氧基	Cl	F
Aa-19	甲基	F	F
Aa-20	乙基	F	F
Aa-21	甲氧基	F	F
Aa-22	甲基	CF ₃	F
Aa-23	乙基	CF ₃	F

	R	R ³	R ⁵
Aa-24	甲氧基	CF ₃	F
Aa-25	甲基	SO ₂ CH ₃	F
Aa-26	乙基	SO ₂ CH ₃	F
Aa-27	甲氧基	SO ₂ CH ₃	F
Aa-28	甲基	CN	F
Aa-29	乙基	CN	F
Aa-30	甲氧基	CN	F
Aa-31	甲基	Cl	Cl
Aa-32	乙基	Cl	Cl
Aa-33	甲氧基	Cl	Cl
Aa-34	甲基	F	Cl
Aa-35	乙基	F	Cl
Aa-36	甲氧基	F	Cl
Aa-37	甲基	CF ₃	Cl
Aa-38	乙基	CF ₃	Cl
Aa-39	甲氧基	CF ₃	Cl
Aa-40	甲基	SO ₂ CH ₃	Cl
Aa-41	乙基	SO ₂ CH ₃	Cl
Aa-42	甲氧基	SO ₂ CH ₃	Cl
Aa-43	甲基	CN	Cl
Aa-44	乙基	CN	Cl
Aa-45	甲氧基	CN	Cl
Aa-46	甲基	H	H

[0296]

	R	R ³	R ⁵
Aa-47	乙基	H	H
Aa-48	甲氧基	H	H
Aa-49	甲基	SCH ₃	H
Aa-50	乙基	SCH ₃	H
Aa-51	甲氧基	SCH ₃	H
Aa-52	甲基	CH ₃	H
Aa-53	乙基	CH ₃	H
Aa-54	甲氧基	CH ₃	H
Aa-55	甲基	OCH ₃	H
Aa-56	乙基	OCH ₃	H

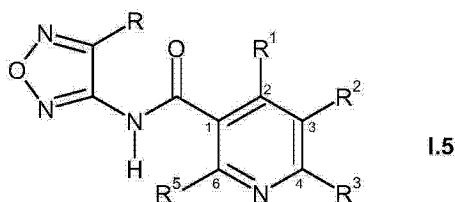
	R	R ³	R ⁵
Aa-57	甲氧基	OCH ₃	H
Aa-58	甲基	CF ₃	H
Aa-59	乙基	CF ₃	H
Aa-60	甲氧基	CF ₃	H
Aa-61	甲基	O-iPr	H
Aa-62	乙基	O-iPr	H
Aa-63	甲氧基	O-iPr	H
Aa-64	甲基	O-cPr	H
Aa-65	乙基	O-cPr	H
Aa-66	甲氧基	O-cPr	H

[0297] cPr = 环丙基 ; iPr = 异丙基。

[0298] 本发明的进一步特别优选实施方案涉及其中 X¹ 为 C-R¹, X² 为 C-R² 且 X⁴ 为 N 的式

I 化合物。该化合物也称为式 I.5 化合物,其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 和 R 如上文对式 I 化合物所定义:

[0299]



[0300] 熟练技术人员易于理解就式 I 化合物而言对 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 和 R 所给优选情形也适用于本文所定义的式 I.5。在式 I.5 中,吡啶环上的位置由阿拉伯数字表示。

[0301] 在式 I.5 化合物中,优选其中变量 R、 R^1 、 R^2 、 R^3 和 R^5 具有下列含义的那些:

[0302] R 为 C_1 - C_4 烷基或 C_1 - C_4 烷氧基,尤其是甲基、乙基、甲氧基或乙氧基;

[0303] R^1 为卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 卤代烷硫基或 C_1 - C_4 烷基磺酰基,尤其是 F、Cl、Br、I、 CH_3 、 CF_3 、 OCH_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 SCF_3 、 $SCHF_2$ 、 SO_2CH_3 或 $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$;

[0304] R^2 为氢、 C_1 - C_2 烷氧基- C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷氧基- C_1 - C_2 烷基、 $S(O)_2$ - C_1 - C_4 烷基、异噁唑基和异噁唑啉基,其中后提到的 2 个基团可以被取代或者带有 1 或 2 个选自卤素和 C_1 - C_4 烷基的基团,尤其是

[0305] R^3 为 H、卤素、CN、 NO_2 、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 卤代烷硫基或 C_1 - C_4 烷基磺酰基,尤其是 H、F、Cl、Br、CN、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 CF_3 、 CHF_2 、 OCH_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 SCH_3 、 SO_2CH_3 或 $SO_2CH_2CH_3$;以及

[0306] R^5 选自氢、氰基、卤素、硝基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 卤代烷基,尤其是氢、卤素、 CHF_2 和 CF_3 。

[0307] 在本发明的该特别优选实施方案中,基团 R^1 、 R^2 、 R^3 和 R^5 一起形成例如在化合物 I.5 的吡啶环上的下列取代方式之一,条件是位置 1 为该吡啶环与该分子的其余部分的连接点: 2-Br、2-Cl、2- CF_3 、2- CH_3 、2- $S(O)_2CH_3$ 、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ 、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -4-CN、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -4-Cl、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -4- CF_3 、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -4- $S(O)_2CH_3$ 、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -4-F、2-Br-4-Cl、2-Cl-4-CN、2, 4- Cl_2 、2-Cl-4-F、2-Cl-4- CF_3 、2-Cl-4- $S(O)_2CH_3$ 、2- CF_3 -4-CN、2- CF_3 -4-Cl、2- CF_3 -4- CF_3 、2- CF_3 -4- $S(O)_2CH_3$ 、2- CF_3 -4-F、2- CH_3 -4-CN、2- CH_3 -4-Cl、2- CH_3 -4- CF_3 、2- CH_3 -4- $S(O)_2CH_3$ 、2- CH_3 -4-F、2- $S(O)_2CH_3$ -4-CN、2- $S(O)_2CH_3$ -4-Cl、2- $S(O)_2CH_3$ -4- CF_3 、2- $S(O)_2CH_3$ -4- $S(O)_2CH_3$ 、2- $S(O)_2CH_3$ -4-F、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -6-Cl、2- $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ -6-F、2-Br-6-Cl、2, 6- Cl_2 、2-Cl-6-F、2- CF_3 -6-Cl、2- CF_3 -6-F、2- CH_3 -6-Cl、2- CH_3 -6-F、2- $S(O)_2CH_3$ -6-Cl、2- $S(O)_2CH_3$ -6-F、2-Br-4, 6- Cl_2 、2, 6- Cl_2 -4-CN、2, 4, 6- Cl_3 、2, 6- Cl_2 -4-F、2, 6- Cl_2 -4- CF_3 、2, 6- Cl_2 -4- $S(O)_2CH_3$ 、2- CF_3 -4-CN-6-Cl、2- CF_3 -4, 6- Cl_2 、2- CF_3 -4- CF_3 -6-Cl、2- CF_3 -4- $S(O)_2CH_3$ -6-Cl、2- CF_3 -4-F-6-Cl、2- CH_3 -4-CN-6-Cl、2- CH_3 -4, 6- Cl_2 、2- CH_3 -4- CF_3 -6-Cl、2- CH_3 -4- $S(O)_2CH_3$ -6-Cl、2- CH_3 -4-F-6-Cl、2- $S(O)_2CH_3$ -4-CN-6-Cl、2- $S(O)_2CH_3$ -4, 6- Cl_2 、2- $S(O)_2CH_3$ -4- CF_3 -6-Cl、

2-S(O)₂CH₃-4-S(O)₂CH₃-6-Cl、2-S(O)₂CH₃-4-F-6-Cl、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-CN-6-Cl、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4, 6-Cl₂、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-CF₃-6-Cl、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-S(O)₂CH₃-6-Cl、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-F-6-Cl、2-Cl-4-CN-6-F、2-Cl-4-CF₃-6-F、2-Cl-4-S(O)₂CH₃-6-F、2, 4-Cl₂-6-F、2-Cl-4, 6-F₂、2-CF₃-4-CN-6-F、2-CF₃-4-CF₃-6-F、2-CF₃-4-S(O)₂CH₃-6-F、2-CF₃-4-Cl-6-F、2-CF₃-4, 6-F₂、2-CH₃-4-CN-6-F、2-CH₃-4-CF₃-6-F、2-CH₃-4-S(O)₂CH₃-6-F、2-CH₃-4-Cl-6-F、2-CH₃-4, 6-F₂、2-S(O)₂CH₃-4-CN-6-F、2-S(O)₂CH₃-4-CF₃-6-F、2-S(O)₂CH₃-4-S(O)₂CH₃-6-F、2-S(O)₂CH₃-4-Cl-6-F、2-S(O)₂CH₃-4, 6-F₂、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-CN-6-F、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-Cl-6-F、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-CF₃-6-F、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4-S(O)₂CH₃-6-F、2-CH₂OCH₂CH₂OCH₃-4, 6-F₂。

[0308] 根据本发明的另一优选实施方案, 变量 R¹、R²、R³ 和 R⁵ 一起形成例如在化合物 I.5 的吡啶环上的下列取代方式之一, 条件是位置 1 为该吡啶环与该分子的其余部分的连接点: 2-Cl-3-(3-异噁唑啉基)-4-CN、2-Cl-3-(3-异噁唑啉基)-4-CF₃、2-Cl-3-(3-异噁唑啉基)-4-S(O)₂CH₃、2, 4-Cl₂-3-(3-异噁唑啉基)、2-Cl-3-(3-异噁唑啉基)-4-F、2-CF₃-3-(3-异噁唑啉基)-4-CN、2-CF₃-3-(3-异噁唑啉基)-4-CF₃、2-CF₃-3-(3-异噁唑啉基)-4-S(O)₂CH₃、2-CF₃-3-(3-异噁唑啉基)-4-Cl、2-CF₃-3-(3-异噁唑啉基)-4-F、2-CH₃-3-(3-异噁唑啉基)-4-CN、2-CH₃-3-(3-异噁唑啉基)-4-CF₃、2-CH₃-3-(3-异噁唑啉基)-4-S(O)₂CH₃、2-CH₃-3-(3-异噁唑啉基)-4-Cl、2-CH₃-3-(3-异噁唑啉基)-4-F、2-S(O)₂CH₃-3-(3-异噁唑啉基)-4-CN、2-S(O)₂CH₃-3-(3-异噁唑啉基)-4-CF₃、2-S(O)₂CH₃-3-(3-异噁唑啉基)-4-S(O)₂CH₃、2-S(O)₂CH₃-3-(3-异噁唑啉基)-4-Cl、2-S(O)₂CH₃-3-(3-异噁唑啉基)-4-F、2-Cl-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-CN、2-Cl-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-CF₃、2-Cl-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-S(O)₂CH₃、2, 4-Cl₂-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)、2-Cl-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-F、2-CF₃-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-CN、2-CF₃-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-CF₃、2-CF₃-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-S(O)₂CH₃、2-CF₃-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-Cl、2-CF₃-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-F、2-CH₃-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-CN、2-CH₃-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-CF₃、2-CH₃-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-S(O)₂CH₃、2-CH₃-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-Cl、2-CH₃-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-F、2-S(O)₂CH₃-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-CN、2-S(O)₂CH₃-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-CF₃、2-S(O)₂CH₃-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-S(O)₂CH₃、2-S(O)₂CH₃-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-Cl 或 2-S(O)₂CH₃-3-(CH₂-O-CH₂CF₃)-4-F。

[0309] 甚至更优选其中变量 R、R¹、R²、R³ 和 R⁵ 具有下含义的式 I.5 化合物:

[0310] R 为 C₁-C₄ 烷基或 C₁-C₄ 烷氧基;

[0311] R¹ 为卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基-C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基-C₁-C₄ 烷氧基-C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₄ 卤代烷硫基或 C₁-C₄ 烷基磺酰基;

[0312] R² 选自氢、C₁-C₂ 烷氧基-C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 卤代烷氧基-C₁-C₂ 烷基、S(O)₂-C₁-C₄ 烷基、异噁唑基和异噁唑啉基, 其中后提到的 2 个基团可以被取代或者带有 1 或 2 个选自卤

素和 C_1-C_4 烷基的基团；

[0313] R^3 选自氢、卤素、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷硫基和 C_1-C_4 烷基磺酰基；以及

[0314] R^5 选自氢、卤素、 CHF_2 和 CF_3 。

[0315] 考虑到它们的用途，特别优选汇编在下表 20-29 中的式 I. 5 化合物。此外，对表中取代基所提到的基团本身为所述取代基的特别优选实施方案，与其中提到它们的组合无关。

[0316] 表 20

[0317] 其中 R^2 为氢且 R 、 R^1 、 R^3 和 R^5 对化合物而言在每种情况下对应于表 Ab 的一行的式 I. 5 化合物（化合物 I. 5-1 至 I. 5-180）；

[0318] 表 21

[0319] 其中 R^2 为 SO_2CH_3 且 R 、 R^1 、 R^3 和 R^5 对化合物而言在每种情况下对应于表 Ab 的一行的式 I. 5 化合物（化合物 I. 5-181 至 I. 5-360）；

[0320] 表 22

[0321] 其中 R^2 为 2, 2, 2- 三氟乙氧基甲基且 R 、 R^1 、 R^3 和 R^5 对化合物而言在每种情况下对应于表 Ab 的一行的式 I. 5 化合物（化合物 I. 5-361 至 I. 5-540）；

[0322] 表 23

[0323] 其中 R^2 为 4, 5- 二氢异噁唑-3- 基且 R 、 R^1 、 R^3 和 R^5 对化合物而言在每种情况下对应于表 Ab 的一行的式 I. 5 化合物（化合物 I. 5-541 至 I. 5-720）；

[0324] 表 24

[0325] 其中 R^2 为 5- 甲基-4, 5- 二氢异噁唑-3- 基且 R 、 R^1 、 R^3 和 R^5 对化合物而言在每种情况下对应于表 Ab 的一行的式 I. 5 化合物（化合物 I. 5-721 至 I. 5-900）；

[0326] 表 25

[0327] 其中 R^2 为 4, 5- 二氢异噁唑-5- 基且 R 、 R^1 、 R^3 和 R^5 对化合物而言在每种情况下对应于表 Ab 的一行的式 I. 5 化合物（化合物 I. 5-901 至 I. 5-1080）；

[0328] 表 26

[0329] 其中 R^2 为 3- 甲基-4, 5- 二氢异噁唑-5- 基且 R 、 R^1 、 R^3 且 R^5 对化合物而言在每种情况下对应于表 Ab 的一行的式 I. 5 化合物（化合物 I. 5-1081 至 I. 5-1260）；

[0330] 表 27

[0331] 其中 R^2 为异噁唑-3- 基且 R 、 R^1 、 R^3 和 R^5 对化合物而言在每种情况下对应于表 Ab 的一行的式 I. 5 化合物（化合物 I. 5-1261 至 I. 5-1440）；

[0332] 表 28

[0333] 其中 R^2 为 5- 甲基异噁唑-3- 基且 R 、 R^1 、 R^3 和 R^5 对化合物而言在每种情况下对应于表 Ab 的一行的式 I. 5 化合物（化合物 I. 5-1441 至 I. 5-1620）；

[0334] 表 29

[0335] 其中 R^2 为 3- 甲基异噁唑-5- 基且 R 、 R^1 、 R^3 和 R^5 对化合物而言在每种情况下对

应于表 Ab 的一行的式 I. 5 化合物（化合物 I. 5-1621 至 I. 5-1800）。

[0336] 表 Ab：

[0337]

	R	R ¹	R ³	R ⁵
Ab-1	CH ₃	Cl	Cl	H
Ab-2	C ₂ H ₅	Cl	Cl	H
Ab-3	OCH ₃	Cl	Cl	H
Ab-4	CH ₃	CH ₃	Cl	H
Ab-5	C ₂ H ₅	CH ₃	Cl	H
Ab-6	OCH ₃	CH ₃	Cl	H
Ab-7	CH ₃	CF ₃	Cl	H
Ab-8	C ₂ H ₅	CF ₃	Cl	H
Ab-9	OCH ₃	CF ₃	Cl	H
Ab-10	CH ₃	SO ₂ CH ₃	Cl	H
Ab-11	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	Cl	H
Ab-12	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	Cl	H
Ab-13	CH ₃	Cl	F	H
Ab-14	C ₂ H ₅	Cl	F	H
Ab-15	OCH ₃	Cl	F	H
Ab-16	CH ₃	CH ₃	F	H

	R	R ¹	R ³	R ⁵
Ab-17	C ₂ H ₅	CH ₃	F	H
Ab-18	OCH ₃	CH ₃	F	H
Ab-19	CH ₃	CF ₃	F	H
Ab-20	C ₂ H ₅	CF ₃	F	H
Ab-21	OCH ₃	CF ₃	F	H
Ab-22	CH ₃	SO ₂ CH ₃	F	H
Ab-23	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	F	H
Ab-24	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	F	H
Ab-25	CH ₃	Cl	CF ₃	H
Ab-26	C ₂ H ₅	Cl	CF ₃	H
Ab-27	OCH ₃	Cl	CF ₃	H
Ab-28	CH ₃	CH ₃	CF ₃	H
Ab-29	C ₂ H ₅	CH ₃	CF ₃	H
Ab-30	OCH ₃	CH ₃	CF ₃	H
Ab-31	CH ₃	CF ₃	CF ₃	H
Ab-32	C ₂ H ₅	CF ₃	CF ₃	H

[0338]

	R	R ¹	R ³	R ⁵
Ab-33	OCH ₃	CF ₃	CF ₃	H
Ab-34	CH ₃	SO ₂ CH ₃	CF ₃	H
Ab-35	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	CF ₃	H
Ab-36	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	CF ₃	H
Ab-37	CH ₃	Cl	SO ₂ CH ₃	H
Ab-38	C ₂ H ₅	Cl	SO ₂ CH ₃	H
Ab-39	OCH ₃	Cl	SO ₂ CH ₃	H
Ab-40	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	H
Ab-41	C ₂ H ₅	CH ₃	SO ₂ CH ₃	H
Ab-42	OCH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	H
Ab-43	CH ₃	CF ₃	SO ₂ CH ₃	H
Ab-44	C ₂ H ₅	CF ₃	SO ₂ CH ₃	H
Ab-45	OCH ₃	CF ₃	SO ₂ CH ₃	H
Ab-46	CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	H
Ab-47	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	H
Ab-48	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	H
Ab-49	CH ₃	Cl	CN	H
Ab-50	C ₂ H ₅	Cl	CN	H
Ab-51	OCH ₃	Cl	CN	H
Ab-52	CH ₃	CH ₃	CN	H
Ab-53	C ₂ H ₅	CH ₃	CN	H
Ab-54	OCH ₃	CH ₃	CN	H
Ab-55	CH ₃	CF ₃	CN	H
Ab-56	C ₂ H ₅	CF ₃	CN	H
Ab-57	OCH ₃	CF ₃	CN	H
Ab-58	CH ₃	SO ₂ CH ₃	CN	H
Ab-59	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	CN	H
Ab-60	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	CN	H
Ab-61	CH ₃	Cl	Cl	F
Ab-62	C ₂ H ₅	Cl	Cl	F
Ab-63	OCH ₃	Cl	Cl	F
Ab-64	CH ₃	CH ₃	Cl	F
Ab-65	C ₂ H ₅	CH ₃	Cl	F
Ab-66	OCH ₃	CH ₃	Cl	F
Ab-67	CH ₃	CF ₃	Cl	F
Ab-68	C ₂ H ₅	CF ₃	Cl	F
Ab-69	OCH ₃	CF ₃	Cl	F
Ab-70	CH ₃	SO ₂ CH ₃	Cl	F
Ab-71	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	Cl	F
Ab-72	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	Cl	F
Ab-73	CH ₃	Cl	F	F
Ab-74	C ₂ H ₅	Cl	F	F
Ab-75	OCH ₃	Cl	F	F
Ab-76	CH ₃	CH ₃	F	F
Ab-77	C ₂ H ₅	CH ₃	F	F
Ab-78	OCH ₃	CH ₃	F	F
Ab-79	CH ₃	CF ₃	F	F

	R	R ¹	R ³	R ⁵
Ab-80	C ₂ H ₅	CF ₃	F	F
Ab-81	OCH ₃	CF ₃	F	F
Ab-82	CH ₃	SO ₂ CH ₃	F	F
Ab-83	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	F	F
Ab-84	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	F	F
Ab-85	CH ₃	Cl	CF ₃	F
Ab-86	C ₂ H ₅	Cl	CF ₃	F
Ab-87	OCH ₃	Cl	CF ₃	F
Ab-88	CH ₃	CH ₃	CF ₃	F
Ab-89	C ₂ H ₅	CH ₃	CF ₃	F
Ab-90	OCH ₃	CH ₃	CF ₃	F
Ab-91	CH ₃	CF ₃	CF ₃	F
Ab-92	C ₂ H ₅	CF ₃	CF ₃	F
Ab-93	OCH ₃	CF ₃	CF ₃	F
Ab-94	CH ₃	SO ₂ CH ₃	CF ₃	F
Ab-95	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	CF ₃	F
Ab-96	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	CF ₃	F
Ab-97	CH ₃	Cl	SO ₂ CH ₃	F
Ab-98	C ₂ H ₅	Cl	SO ₂ CH ₃	F
Ab-99	OCH ₃	Cl	SO ₂ CH ₃	F
Ab-100	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	F
Ab-101	C ₂ H ₅	CH ₃	SO ₂ CH ₃	F
Ab-102	OCH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	F
Ab-103	CH ₃	CF ₃	SO ₂ CH ₃	F
Ab-104	C ₂ H ₅	CF ₃	SO ₂ CH ₃	F
Ab-105	OCH ₃	CF ₃	SO ₂ CH ₃	F
Ab-106	CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	F
Ab-107	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	F
Ab-108	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	F
Ab-109	CH ₃	Cl	CN	F
Ab-110	C ₂ H ₅	Cl	CN	F
Ab-111	OCH ₃	Cl	CN	F
Ab-112	CH ₃	CH ₃	CN	F
Ab-113	C ₂ H ₅	CH ₃	CN	F
Ab-114	OCH ₃	CH ₃	CN	F
Ab-115	CH ₃	CF ₃	CN	F
Ab-116	C ₂ H ₅	CF ₃	CN	F
Ab-117	OCH ₃	CF ₃	CN	F
Ab-118	CH ₃	SO ₂ CH ₃	CN	F
Ab-119	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	CN	F
Ab-120	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	CN	F
Ab-121	CH ₃	Cl	Cl	Cl
Ab-122	C ₂ H ₅	Cl	Cl	Cl
Ab-123	OCH ₃	Cl	Cl	Cl
Ab-124	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl
Ab-125	C ₂ H ₅	CH ₃	Cl	Cl
Ab-126	OCH ₃	CH ₃	Cl	Cl

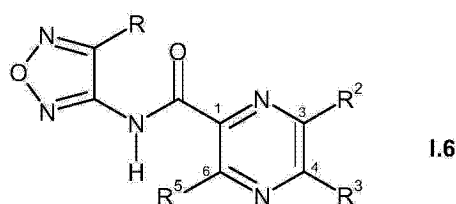
[0339]

	R	R ¹	R ³	R ⁵
Ab-127	CH ₃	CF ₃	Cl	Cl
Ab-128	C ₂ H ₅	CF ₃	Cl	Cl
Ab-129	OCH ₃	CF ₃	Cl	Cl
Ab-130	CH ₃	SO ₂ CH ₃	Cl	Cl
Ab-131	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	Cl	Cl
Ab-132	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	Cl	Cl
Ab-133	CH ₃	Cl	F	Cl
Ab-134	C ₂ H ₅	Cl	F	Cl
Ab-135	OCH ₃	Cl	F	Cl
Ab-136	CH ₃	CH ₃	F	Cl
Ab-137	C ₂ H ₅	CH ₃	F	Cl
Ab-138	OCH ₃	CH ₃	F	Cl
Ab-139	CH ₃	CF ₃	F	Cl
Ab-140	C ₂ H ₅	CF ₃	F	Cl
Ab-141	OCH ₃	CF ₃	F	Cl
Ab-142	CH ₃	SO ₂ CH ₃	F	Cl
Ab-143	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	F	Cl
Ab-144	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	F	Cl
Ab-145	CH ₃	Cl	CF ₃	Cl
Ab-146	C ₂ H ₅	Cl	CF ₃	Cl
Ab-147	OCH ₃	Cl	CF ₃	Cl
Ab-148	CH ₃	CH ₃	CF ₃	Cl
Ab-149	C ₂ H ₅	CH ₃	CF ₃	Cl
Ab-150	OCH ₃	CH ₃	CF ₃	Cl
Ab-151	CH ₃	CF ₃	CF ₃	Cl
Ab-152	C ₂ H ₅	CF ₃	CF ₃	Cl
Ab-153	OCH ₃	CF ₃	CF ₃	Cl

	R	R ¹	R ³	R ⁵
Ab-154	CH ₃	SO ₂ CH ₃	CF ₃	Cl
Ab-155	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	CF ₃	Cl
Ab-156	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	CF ₃	Cl
Ab-157	CH ₃	Cl	SO ₂ CH ₃	Cl
Ab-158	C ₂ H ₅	Cl	SO ₂ CH ₃	Cl
Ab-159	OCH ₃	Cl	SO ₂ CH ₃	Cl
Ab-160	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	Cl
Ab-161	C ₂ H ₅	CH ₃	SO ₂ CH ₃	Cl
Ab-162	OCH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	Cl
Ab-163	CH ₃	CF ₃	SO ₂ CH ₃	Cl
Ab-164	C ₂ H ₅	CF ₃	SO ₂ CH ₃	Cl
Ab-165	OCH ₃	CF ₃	SO ₂ CH ₃	Cl
Ab-166	CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	Cl
Ab-167	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	Cl
Ab-168	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	Cl
Ab-169	CH ₃	Cl	CN	Cl
Ab-170	C ₂ H ₅	Cl	CN	Cl
Ab-171	OCH ₃	Cl	CN	Cl
Ab-172	CH ₃	CH ₃	CN	Cl
Ab-173	C ₂ H ₅	CH ₃	CN	Cl
Ab-174	OCH ₃	CH ₃	CN	Cl
Ab-175	CH ₃	CF ₃	CN	Cl
Ab-176	C ₂ H ₅	CF ₃	CN	Cl
Ab-177	OCH ₃	CF ₃	CN	Cl
Ab-178	CH ₃	SO ₂ CH ₃	CN	Cl
Ab-179	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	CN	Cl
Ab-180	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	CN	Cl

[0340] 本发明的进一步非常优选实施方案涉及其中 X¹ 为 N, X⁴ 为 N 且 X² 为 CR² 的式 I 化合物。这些化合物称为式 I. 6 化合物, 其中 R²、R³、R⁵ 和 R 如上文对式 I 化合物所定义:

[0341]



[0342] 熟练技术人员易于理解就式 I 化合物而言对 R²、R³、R⁵ 和 R 所给优选情形也适用于本文所定义的式 I. 6。在式 I. 6 中, 吡嗪环上的位置由阿拉伯数字表示。

[0343] 在式 I. 6 化合物中, 优选其中 R²、R³、R⁵ 和 R 具有上述优选含义的那些。尤其更优选如下式 I. 6 化合物, 其中 R³、R⁵ 和 R 具有上述优选含义且变量 R² 选自氢、C₁-C₂ 烷氧基 -C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 卤代烷氧基 -C₁-C₂ 烷基、S(O)₂-C₁-C₄ 烷基、异噁唑基和异噁唑啉基, 其中后提到的 2 个基团可以被取代或者带有 1 或 2 个选自卤素和 C₁-C₄ 烷基的基团。R² 尤其选自氢、甲氧基甲基、乙氧基甲基、2, 2, 2- 三氟乙氧基甲基、2, 2, 2- 三氟乙氧基乙基、甲基磺酰基、4, 5- 二氢异噁唑 -5- 基、4, 5- 二氢异噁唑 -3- 基、3- 甲基 -4, 5- 二氢异噁唑 -5- 基、

5-甲基-4,5-二氢异噁唑-3-基、异噁唑-5-基、3-甲基异噁唑-5-基、异噁唑-3-基和5-甲基异噁唑-3-基。

[0344] 在本发明的该特别优选实施方案中,基团 R^2 、 R^3 和 R^5 一起形成例如在化合物 I.6 的吡啶环上的下列取代方式之一,条件是位置 1 为该吡啶环与该分子的其余部分的连接点:4,6- Cl_2 、4-CN-6-Cl、4-F-6-Cl、4- CF_3 -6-Cl、4-S(O) $_2$ CH $_3$ -6-Cl、4-CN-6-F、4- CF_3 -6-F、4-S(O) $_2$ CH $_3$ -6-F、4-Cl-6-F、4,6-F $_2$ 、4-Cl-6- CF_3 、4-CN-6- CF_3 、4-F-6- CF_3 、4- CF_3 -6- CF_3 、4-S(O) $_2$ CH $_3$ -6- CF_3 、4-Cl-6-CH $_3$ 、4-CN-6-CH $_3$ 、4-F-6-CH $_3$ 、4- CF_3 -6-CH $_3$ 、4-S(O) $_2$ CH $_3$ -6-CH $_3$ 、4-Cl-6- CHF_2 、4-CN-6- CHF_2 、4-F-6- CHF_2 、4- CF_3 -6- CHF_2 、4-S(O) $_2$ CH $_3$ -6- CHF_2 、6-Cl、6-F、6- CF_3 、6-CH $_3$ 、6- CHF_2 。

[0345] 更优选其中变量 R 、 R^2 、 R^3 和 R^5 具有下列含义的式 I.6 化合物:

[0346] R 选自 C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 烷氧基,尤其是甲基、乙基、甲氧基或乙氧基;

[0347] R^2 选自氢、 C_1 - C_2 烷氧基- C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷氧基- C_1 - C_2 烷基、S(O) $_2$ - C_1 - C_4 烷基、异噁唑基和异噁唑啉基,其中后提到的 2 个基团可以被取代或者带有 1 或 2 个选自卤素和 C_1 - C_4 烷基的基团,尤其是氢、甲氧基甲基、乙氧基甲基、2,2,2-三氟乙氧基甲基、2,2,2-三氟乙氧基乙基、甲基磺酰基、4,5-二氢异噁唑-5-基、4,5-二氢异噁唑-3-基、3-甲基-4,5-二氢异噁唑-5-基、5-甲基-4,5-二氢异噁唑-3-基、异噁唑-5-基、3-甲基异噁唑-5-基、异噁唑-3-基和 5-甲基异噁唑-3-基;

[0348] R^3 选自氢、卤素、CN、NO $_2$ 、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷硫基和 C_1 - C_4 烷基磺酰基,尤其是 Cl、F、 CF_3 、SO $_2$ CH $_3$ 或 CN;以及

[0349] R^5 选自氢、氰基、卤素、硝基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 卤代烷基,尤其是氢、卤素、CH $_3$ 、 CHF_2 和 CF_3 。

[0350] 甚至更优选其中变量 R 、 R^2 、 R^3 和 R^5 具有下列含义的式 I.6 化合物:

[0351] R 选自 C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 烷氧基;

[0352] R^2 选自氢、 C_1 - C_2 烷氧基- C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷氧基- C_1 - C_2 烷基、S(O) $_2$ - C_1 - C_4 烷基、异噁唑基和异噁唑啉基,其中后提到的 2 个基团可以被取代或者带有 1 或 2 个选自卤素和 C_1 - C_4 烷基的基团;

[0353] R^3 选自氢、卤素、CN、NO $_2$ 、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷硫基和 C_1 - C_4 烷基磺酰基;以及

[0354] R^5 选自氢、卤素、CH $_3$ 、 CHF_2 和 CF_3 。

[0355] 考虑到它们的用途,特别优选汇编在下表 30-39 中的式 I.6 化合物。此外,对表中取代基所提到的基团本身为所述取代基的特别优选实施方案,与其中提到它们的组合无关。

[0356] 表 30

[0357] 其中 R^2 为氢且 R 、 R^3 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 Aa 的一行的式 I.6 化合物(化合物 I.6-1 至 I.6-66);

[0358] 表 31

[0359] 其中 R^2 为 SO_2CH_3 且 R 、 R^3 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 Aa 的一行的式 I. 6 化合物（化合物 I. 6-67 至 I. 6-132）；

[0360] 表 32

[0361] 其中 R^2 为 2, 2, 2- 三氟乙氧基甲基且 R 、 R^3 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 Aa 的一行的式 I. 6 化合物（化合物 I. 6-133 至 I. 6-198）；

[0362] 表 33

[0363] 其中 R^2 为 4, 5- 二氢异噁唑-3- 基且 R 、 R^3 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 Aa 的一行的式 I. 6 化合物（化合物 I. 6-199 至 I. 6-264）；

[0364] 表 34

[0365] 其中 R^2 为 5- 甲基-4, 5- 二氢异噁唑-3- 基且 R 、 R^3 、 R^4 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 Aa 的一行的式 I. 6 化合物（化合物 I. 6-265 至 I. 6-330）；

[0366] 表 35

[0367] 其中 R^2 为 4, 5- 二氢异噁唑-5- 基且 R 、 R^3 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 Aa 的一行的式 I. 6 化合物（化合物 I. 6-331 至 I. 6-396）；

[0368] 表 36

[0369] 其中 R^2 为 3- 甲基-4, 5- 二氢异噁唑-5- 基且 R 、 R^3 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 Aa 的一行的式 I. 6 化合物（化合物 I. 6-397 至 I. 6-462）；

[0370] 表 37

[0371] 其中 R^2 为异噁唑-3- 基且 R 、 R^3 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 Aa 的一行的式 I. 6 化合物（化合物 I. 6-463 至 I. 6-528）；

[0372] 表 38

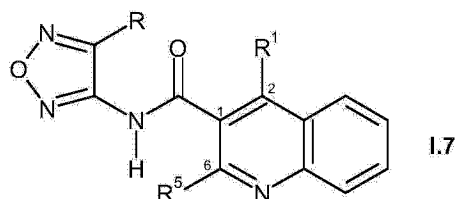
[0373] 其中 R^2 为 5- 甲基异噁唑-3- 基且 R 、 R^3 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 Aa 的一行的式 I. 6 化合物（化合物 I. 6-529 至 I. 6-594）；

[0374] 表 39

[0375] 其中 R^2 为 3- 甲基异噁唑-5- 基且 R 、 R^3 和 R^5 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 Aa 的一行的式 I. 6 化合物（化合物 I. 6-595 至 I. 6-660）；

[0376] 本发明的进一步特别优选实施方案涉及其中 X^1 为 C-R^1 ， X^2 为 CR^2 ， X^4 为 N 且 R^2 与 R^3 一起形成稠合 6 员碳环的式 I 化合物。该化合物也称为式 I. 7 化合物，其中 R^1 、 R^5 和 R 如上文对式 I 化合物所定义：

[0377]



[0378] 熟练技术人员易于理解就式 I 化合物而言对 R^1 、 R^5 和 R 所给优选情形也适用于本文所定义的式 I. 7。在式 I. 7 中，喹啉环上的位置由阿拉伯数字表示。

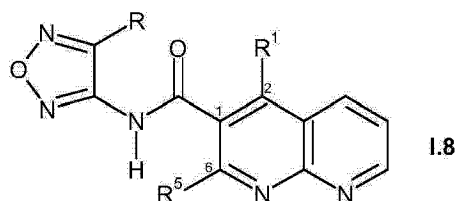
[0397]

	R	R ¹
Ac-1	CH ₃	Cl

Ac-2	CH ₂ CH ₃	Cl
Ac-3	OCH ₃	Cl
Ac-4	CH ₃	CH ₃
Ac-5	CH ₂ CH ₃	CH ₃
Ac-6	OCH ₃	CH ₃
Ac-7	CH ₃	CF ₃
Ac-8	CH ₂ CH ₃	CF ₃
Ac-9	OCH ₃	CF ₃
Ac-10	CH ₃	SO ₂ CH ₃
Ac-11	CH ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃
Ac-12	OCH ₃	SO ₂ CH ₃

[0398] 本发明的进一步特别优选实施方案涉及其中 X¹ 为 C-R¹, X² 为 CR², X⁴ 为 N 且 R² 与 R³ 一起形成稠合 6 员杂环的式 I 化合物, 其中该稠合杂环具有 1 个氮原子作为环成员。该化合物也称为式 I. 8 化合物, 其中 R¹、R⁵ 和 R 如上文对式 I 化合物所定义:

[0399]



[0400] 熟练技术人员易于理解就式 I 化合物而言对 R¹、R⁵ 和 R 所给优选情形也适用于下文所定义的式 I. 8。在式 I. 8 中, [1, 8]-二氮杂萘环上的位置由阿拉伯数字表示。

[0401] 在式 I. 8 化合物中, 优选其中 R⁵ 和 R 具有优选含义且变量 R¹ 选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₄ 卤代烷硫基和 C₁-C₄ 烷基磺酰基, 尤其选自 F、Cl、Br、CH₃、CF₃、OCH₃、OCF₃、OCHF₂、SCF₃、SCHF₂、SO₂CH₃ 和 CH₂OCH₂CH₂OCH₃ 的那些。

[0402] 在本发明的该特别优选实施方案中, 基团 R¹ 和 R⁵ 一起形成例如在化合物 I. 8 的吡啶环上的下列取代方式之一, 条件是位置 1 为该吡啶环与该分子的其余部分的连接点: 2-Br、2-Cl、2-CF₃、2-CH₃、2-S(O)₂CH₃、2-Br-6-Cl、2, 6-Cl₂、2-Cl-6-F、2-CF₃-6-Cl、2-CF₃-6-F、2-CH₃-6-Cl、2-CH₃-6-F、2-S(O)₂CH₃-6-Cl、2-S(O)₂CH₃-6-F。

[0403] 更优选其中变量 R、R¹ 和 R⁵ 具有下列含义的式 I. 8 化合物:

[0404] R 为 C₁-C₄ 烷基或 C₁-C₄ 烷氧基, 尤其是甲基、乙基、甲氧基或乙氧基;

[0405] R¹ 为卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷氧

基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₄ 卤代烷硫基或 C₁-C₄ 烷基磺酰基, 尤其是 F、Cl、Br、I、CH₃、CF₃、OCH₃、OCF₃、OCHF₂、CH₂OCH₂CH₂OCH₃、SCF₃、SCHF₂ 或 SO₂CH₃; 以及

[0406] R⁵ 选自氢、氰基、卤素、硝基、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 卤代烷基, 尤其是氢、卤素、CHF₂ 和 CF₃。

[0407] 甚至更优选其中变量 R、R¹ 和 R⁵ 具有下列含义的式 I. 8 化合物:

[0408] R 为 C₁-C₄ 烷基或 C₁-C₄ 烷氧基;

[0409] R¹ 为卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₄ 卤代烷硫基或 C₁-C₄ 烷基磺酰基; 以及

[0410] R⁵ 选自氢、卤素、CHF₂ 和 CF₃。

[0411] 考虑到它们的用途, 特别优选汇编在下表 43-45 中的式 I. 8 化合物。此外, 对表中取代基所提到的基团本身为所述取代基的特别优选实施方案, 与其中提到它们的组合无关。

[0412] 表 43

[0413] 其中 R⁵ 为氢且 R 和 R¹ 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 Ac 的一行的式 I. 8 化合物 (化合物 I. 8-1 至 I. 8-12);

[0414] 表 44

[0415] 其中 R⁵ 为氟且 R 和 R¹ 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 Ac 的一行的式 I. 8 化合物 (化合物 I. 8-13 至 I. 8-24);

[0416] 表 45

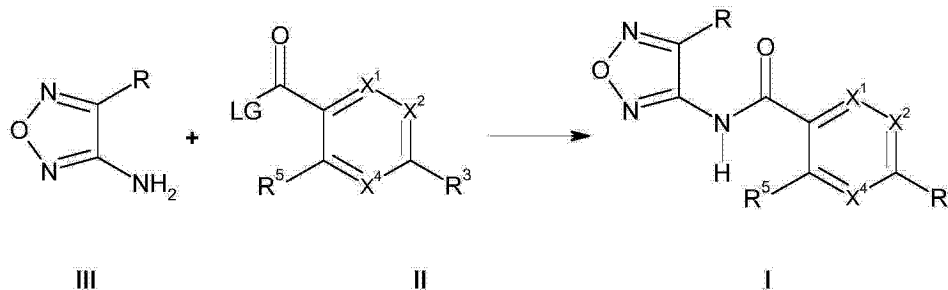
[0417] 其中 R⁵ 为氯且 R 和 R¹ 的组合对化合物而言在每种情况下对应于表 Ac 的一行的式 I. 8 化合物 (化合物 I. 8-25 至 I. 8-36)。

[0418] 式 I 化合物可以通过有机化学的标准方法制备, 例如通过下面在方案 1-5 中所述方法制备。若无其他说明, 方案 1-5 中的取代基、变量和指数如上面对式 I 所定义。

[0419] 式 I 化合物例如可以如下面的方案 1 所示制备。

[0420] 方案 1:

[0421]



[0422] 在方案 1 中, R、X¹、X²、X⁴、R³ 和 R⁵ 如上所定义。LG 为离去基团, 如卤素, 尤其是 Cl, 酸酐残基或活化酯残基。

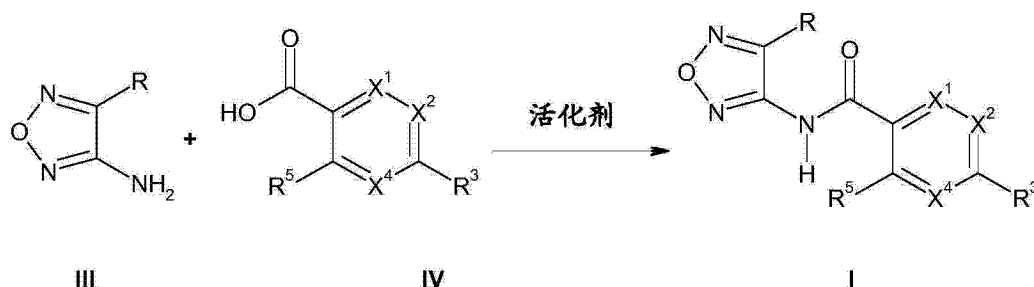
[0423] 可以使式 III 的 4-氨基-1, 2, 5-噁二唑化合物与式 II 的苯甲酰基衍生物反应而得到式 I 化合物。尤其是在 LG 为卤素的情况下, 该反应适当地在碱存在下进行。合适的

碱例如为碳酸盐,如碳酸锂、碳酸钠或碳酸钾,胺,如三甲胺或三乙胺,以及碱性 N- 杂环,如吡啶、2,6- 二甲基吡啶或 2,4,6- 三甲基吡啶。合适的溶剂尤其是非质子溶剂如戊烷、己烷、庚烷、辛烷、环己烷、二氯甲烷、氯仿、1,2- 二氯乙烷、苯、氯苯、甲苯、二甲苯类、二氯苯、三甲基苯、吡啶、2,6- 二甲基吡啶、2,4,6- 三甲基吡啶、乙腈、乙醚、四氢呋喃、2- 甲基四氢呋喃、甲基叔丁基醚、1,4- 二噁烷、N,N- 二甲基甲酰胺、N- 甲基吡咯烷酮或其混合物。原料通常以等摩尔量或近乎等摩尔量在通常为 -20°C 至 100°C , 优选 -5°C 至 50°C 的反应温度下相互反应。

[0424] 或者,式 I 化合物还可以如方案 2 所示制备。

[0425] 方案 2 :

[0426]



[0427] 在方案 2 中, R、 X^1 、 X^2 、 X^4 、 R^3 和 R^5 如上所定义。

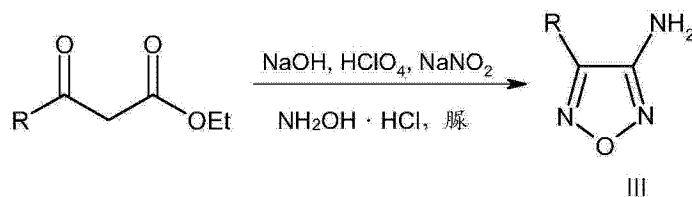
[0428] 4-氨基-1,2,5-噁二唑化合物 III 与式 IV 的苯甲酸衍生物反应得到化合物 I。该反应优选在将化合物 IV 的酸基转化成活化酯或酰胺的合适活化剂存在下进行。为此可以使用本领域已知的活化剂,如 1,1'- 羰基二咪唑 (CDI)、二环己基碳二亚胺 (DCC)、1- 乙基-3-(3-二甲氨基丙基) 碳二亚胺 (EDC) 或 2,4,6- 三丙基-1,3,5,2,4,6- 三氧杂三磷杂己环-2,4,6- 三氧化物 (T3P)。活化酯或酰胺尤其取决于所用具体活化剂可以通过使化合物 IV 与该活化剂在化合物 III 存在下接触而就地形成,或者可以在分开的步骤中在与化合物 III 反应之前形成。尤其在将 DCC 或 EDC 用作活化剂的情况下可能有利的是在活化反应中引入其他添加剂,如羟基苯并三唑 (HOBt)、硝基苯酚、五氟苯酚、2,4,5- 三氯苯酚或 N- 羟基琥珀酰亚胺。可能进一步有利的是在碱如叔胺存在下制备该活化酯或酰胺。该活化酯或酰胺就地或者随后与式 III 的胺反应而得到式 I 的酰胺。该反应通常在无水惰性溶剂如氯代烃,例如二氯甲烷或二氯乙烷,醚,例如四氢呋喃或 1,4- 二噁烷,或羧酰胺,例如 N,N- 二甲基甲酰胺、N,N- 二甲基乙酰胺或 N- 甲基吡咯烷酮中进行。该反应通常在 -20°C 至 $+25^{\circ}\text{C}$ 的温度下进行。

[0429] 式 II 化合物及其式 IV 的相应苯甲酸前体可以购买得到或者可以通过本领域已知的方法或在文献中,例如在 W02000039094、W02009115788、EP316491 和 EP283261 中公开的方法制备。

[0430] 式 III 的 4-氨基-1,2,5-噁二唑化合物可市购或者可以根据由文献已知的方法得到。例如,3- 烷基-4-氨基-1,2,5-噁二唑可以根据 Russian Chemical Bulletin, Int. Ed., 54(4), 1032-1037 (2005) 中所述方法如方案 3 所示由 β - 酮酯制备。

[0431] 方案 3 :

[0432]

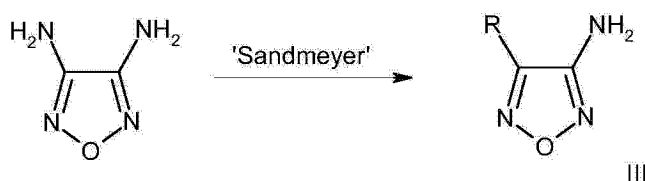


[0433] 在方案 3 中, R 如上所定义且 Et 为乙基。

[0434] 如方案 4 所示, 其中 R 为卤素的式 III 化合物可以根据文献中所述程序, 例如通过 Heteroatom Chemistry, 15 (3), 199-207 (2004) 中所公开的 Sandmeyer 类型反应由市售 3, 4-二氨基-1, 2, 5-噁二唑制备。

[0435] 方案 4 :

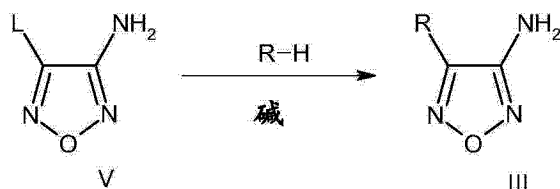
[0436]



[0437] 如方案 5 所示, 其中 R 为亲核残基的式 III 化合物可以根据例如在 Journal of Chemical Research, Synopses (6), 190 (1985), Izvestiya Akademii Nauk SSSR, Seriya Khimicheskaya (9), 2086-8 (1986) 或 Russian Chemical Bulletin (Translation of Izvestiya Akademii Nauk, Seriya Khimicheskaya), 53 (3), 596-614 (2004) 中所公开的程序通过经由离去基团 L, 例如卤素的取代在式 V 的 1, 2, 5-噁二唑化合物的 4 位引入亲核残基而制备。

[0438] 方案 5 :

[0439]



[0440] 式 I 化合物—包括其立体异构体、盐、互变异构体和 N-氧化物—及其在该合成方法中的前体通常可以通过上述方法制备。若各化合物不能经由上述途径制备, 则它们可以通过衍生其他化合物 I 或相应前体或通过所述合成途径的常规改性而制备。例如在各种情况下可以有利地通过衍生, 例如通过酯水解、酰胺化、酯化、醚裂解、烯烃化、还原、氧化等或者通过所述合成途径的常规改性由其他式 I 化合物制备某些式 I 化合物。

[0441] 反应混合物以常规方式后处理, 例如与水混合, 分离各相以及合适的话例如在氧化铝或硅胶上层析提纯粗产物。某些中间体和终产物可以以无色或浅褐色粘稠油形式得到, 将它们在减压和温和升高的温度下除去或提纯挥发性组分。若中间体和终产物以固体得到, 则可以通过重结晶或浸煮进行提纯。

[0442] 化合物 I 及其可农用盐可以用作除草剂。它们可以直接使用或可以作为适当配制的组合物使用。包含化合物 I (尤其是其优选方面) 的除草组合物非常有效地防治非作物

区域的植物生长,尤其是在高施用率下。它们在作物如小麦、稻、玉米、大豆和棉花中作用于阔叶杂草和禾本科杂草而不对农作物引起任何显著的损害。该效果主要在低施用率下观察到。

[0443] 取决于所述施用方法,化合物 I,尤其是其优选方面,或者包含它们的组合可以额外用于许多其他农作物以消除不希望的植物。合适的作物实例如下:洋葱 (*Allium cepa*)、凤梨 (*Ananas comosus*)、落花生 (*Arachis hypogaea*)、石刁柏 (*Asparagus officinalis*)、燕麦 (*Avena sativa*)、甜菜 (*Beta vulgaris spec. altissima*)、甜菜 (*Beta vulgaris spec. rapa*)、欧洲油菜 (*Brassica napus var. napus*)、芜菁甘蓝 (*Brassica napus var. napobrassica*)、芜菁 (*Brassica rapa var. silvestris*)、羽衣甘蓝 (*Brassica oleracea*)、黑芥 (*Brassica nigra*)、大叶茶 (*Camellia sinensis*)、红花 (*Carthamus tinctorius*)、美国山核桃 (*Carya illinoensis*)、柠檬 (*Citrus limon*)、甜橙 (*Citrus sinensis*)、小果咖啡 (*Coffea arabica*) (中果咖啡 (*Coffea canephora*)、大果咖啡 (*Coffea liberica*))、黄瓜 (*Cucumis sativus*)、狗牙根 (*Cynodon dactylon*)、胡萝卜 (*Daucus carota*)、油棕 (*Elaeis guineensis*)、欧洲草莓 (*Fragaria vesca*)、大豆 (*Glycine max*)、陆地棉 (*Gossypium hirsutum*) (树棉 (*Gossypium arboreum*)、草棉 (*Gossypium herbaceum*)、*Gossypium vitifolium*)、向日葵 (*Helianthus annuus*)、*Hevea brasiliensis*、大麦 (*Hordeum vulgare*)、啤酒花 (*Humulus lupulus*)、甘薯 (*Ipomoea batatas*)、核桃 (*Juglans regia*)、兵豆 (*Lens culinaris*)、亚麻 (*Linum usitatissimum*)、番茄 (*Lycopersicon lycopersicum*)、苹果属 (*Malus spec.*)、木薯 (*Manihot esculenta*)、紫苜蓿 (*Medicago sativa*)、芭蕉属 (*Musa spec.*)、烟草 (*Nicotiana tabacum*) (黄花烟草 (*N. rustica*))、油橄榄 (*Olea europaea*)、稻 (*Oryza sativa*)、金甲豆 (*Phaseolus lunatus*)、菜豆 (*Phaseolus vulgaris*)、欧洲云杉 (*Picea abies*)、松属 (*Pinus spec.*)、开心果 (*Pistacia vera*)、*Pisum sativum*、欧洲甜樱桃 (*Prunus avium*)、*Prunus persica*、西洋梨 (*Pyrus communis*)、杏 (*Prunus armeniaca*)、欧洲酸樱桃 (*Prunus cerasus*)、扁桃 (*Prunus dulcis*) 和欧洲李 (*Prunus domestica*)、*Ribes sylvestre*、蓖麻 (*Ricinus communis*)、甘蔗 (*Saccharum officinarum*)、黑麦 (*Secale cereale*)、白芥 (*Sinapis alba*)、马铃薯 (*Solanum tuberosum*)、两色蜀黍 (*Sorghum bicolor*) (高粱 (*S. vulgare*))、可可树 (*Theobroma cacao*)、红车轴草 (*Trifolium pratense*)、普通小麦 (*Triticum aestivum*)、小黑麦 (*Triticale*)、硬粒小麦 (*Triticum durum*)、蚕豆 (*Vicia faba*)、葡萄 (*Vitis vinifera*)、玉蜀黍 (*Zea mays*)。

[0444] 术语“农作物”还包括已经通过育种、诱变或基因工程修饰的植物。基因修饰植物是其基因材料以在自然条件下不通过杂交、突变或自然重组 (即基因信息的重组) 发生的方式修饰的植物。此处通常将一个或多个基因整合到植物的基因材料中以改善植物性能。

[0445] 因此,术语“农作物”还包括已经通过育种和基因工程而获得对某些类别的除草剂的耐受性的植物,所述除草剂例如羟基苯基丙酮酸双加氧酶 (HPPD) 抑制剂,乙酰乳酸合成酶 (ALS) 抑制剂如磺酰脲类 (EP-A-0257993, US5, 013, 659) 或咪唑啉酮类 (例如 见 US6, 222, 100、W001/82685、W000/26390、W097/41218、W098/02526、W098/02527、W004/106529、W005/20673、W003/14357、W003/13225、W003/14356、W004/16073), 烯醇丙酮酰莽草酸 3- 磷酸合成酶 (EPSPS) 抑制剂如草甘膦 (glyphosate) (例如见 W092/00377), 谷氨酰胺合成酶 (GS) 抑制剂如草铵膦 (glufosinate) (例如见 EP-A-0242236、EP-A-242246)

或苯腈类 (oxynil) 除草剂 (例如见 US5, 559, 024)。

[0446] 许多农作物如 **Clearfield**[®] 油菜已经借助常规育种 (诱变) 方法而耐受咪唑啉酮类如咪草啞酸 (imazamox)。已经借助基因工程方法产生耐受草甘膦或草铵膦的农作物如大豆、棉花、玉米、甜菜和油菜, 它们可以以商标名 **RoundupReady**[®] (耐受草甘膦) 和 **Liberty Link**[®] (耐受草铵膦) 市购。

[0447] 因此, 术语“农作物”还包括借助基因工程而产生一种或多种毒素如芽孢杆菌属 (*Bacillus*) 细菌菌株的那些的植物。由该类基因修饰植物产生的毒素例如包括芽孢杆菌属, 尤其是苏云金芽孢杆菌 (*B. thuringiensis*) 的杀虫蛋白如内毒素 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1、Cry9c、Cry34Ab1 或 Cry35Ab1; 或无性杀虫蛋白 (VIP), 例如 VIP1、VIP2、VIP3 或 VIP3A; 线虫定居细菌的杀虫蛋白, 例如发光杆菌属 (*Photobacterium*) 或致病杆菌属 (*Xenorhabdus*); 动物有机体的毒素如黄蜂、蜘蛛或蝎子毒素; 真菌毒素, 例如来自链霉菌属 (*Streptomyces*); 植物凝集素, 例如来自豌豆或大麦; 凝集素, 蛋白酶抑制剂, 例如胰蛋白酶抑制剂, 丝氨酸蛋白酶抑制剂, patatin, 半胱氨酸蛋白酶抑制剂或木瓜蛋白酶抑制剂, 核糖体失活蛋白 (RIP), 例如蓖麻蛋白、玉米 -RIP、相思豆毒蛋白、丝瓜籽蛋白、皂草素或异株腹泻毒蛋白 (bryodin); 类固醇代谢酶, 例如 3- 羟基类固醇氧化酶、蜕皮甾类 -IDP 糖基转移酶、胆固醇氧化酶、蜕皮激素抑制剂或 HMG-CoA 还原酶; 离子通道阻断剂, 例如钠通道或钙通道抑制剂; 保幼激素酯酶; 利尿激素受体 (helicokinin 受体); 萜合成酶, 联苳合成酶, 壳多糖酶和葡聚糖酶。在植物中, 这些毒素还可以作为前毒素、杂合蛋白或截短的或其他方面改性的蛋白产生。杂合蛋白的特征在于不同蛋白域的新型组合 (例如参见 W02002/015701)。该类毒素或产生这些毒素的基因修饰植物的其他实例公开于 EP-A374 753、W093/007278、W095/34656、EP-A427 529、EP-A451 878、W003/018810 和 W003/052073 中。生产这些基因修饰植物的方法对本领域熟练技术人员是已知的且例如公开于上述出版物中。许多上述毒素赋予产生它们的植物以对所有分类学上为节肢动物的害虫, 尤其是甲虫 (鞘翅目 (*Coeleroptera*))、双翅目昆虫 (双翅目 (*Diptera*)) 和蝴蝶 (鳞翅目 (*Lepidoptera*)) 以及线虫 (线虫纲 (*Nematoda*)) 的耐受性。

[0448] 对杀虫毒素产生一个或多个基因编码的基因修饰植物例如描述于上述出版物中, 它们中的一些可市购, 例如 **YieldGard**[®] (产生毒素 Cry1Ab 的玉米品种), **YieldGard**[®] Plus (产生毒素 Cry1Ab 和 Cry3Bb1 的玉米品种), **Starlink**[®] (产生毒素 Cry9c 的玉米品种), **Herculex**[®] RW (产生毒素 Cry34Ab1、Cry35Ab1 和酶膦丝菌素 -N- 乙酰转移酶 [PAT] 的玉米品种); **NuCOTN**[®] 33B (产生毒素 Cry1Ac 的棉花品种), **Bollgard**[®] I (产生毒素 Cry1Ac 的棉花品种), **Bollgard**[®] II (产生毒素 Cry1Ac 和 Cry2Ab2 的棉花品种); **VIPcot**[®] (产生 VIP 毒素的棉花品种); **NewLeaf**[®] (产生毒素 Cry3A 的土豆品种); **Bt-Xtra**[®], **NatureGard**[®], **KnockOut**[®], **BiteGard**[®], **Protecta**[®], Bt11 (例如 **Agrisure**[®] CB) 和法国 Syngenta Seeds SAS 的

Bt176(产生毒素 Cry1Ab 和 PAT 酶的玉米品种),法国 Syngenta Seeds SAS 的 MIR604(产生毒素 Cry3A 的修饰译本的玉米品种,见 W003/018810),比利时 Monsanto Europe S. A. 的 MON863(产生毒素 Cry3Bb1 的玉米品种),比利时 Monsanto Europe S. A. 的 IPC531(产生毒素 Cry1Ac 的修饰译本的棉花品种)和比利时 Pioneer Overseas Corporation 的 1507(产生毒素 Cry1F 和 PAT 酶的玉米品种)。

[0449] 因此,术语“农作物”还包括借助基因工程产生一种或多种更强壮或对细菌、病毒或真菌病原体的耐受性增强的蛋白质的植物,例如与发病机理相关的蛋白(PR 蛋白,参见 EP-A 0 392 225),抗性蛋白(例如产生两种针对来自野生墨西哥土豆 *Solanum bulbocastanum* 的致病疫霉 (*Phytophthora infestans*) 的抗性基因的土豆品种)或 T4 溶菌酶(例如通过产生该蛋白而耐受细菌如 *Erwinia amylovora* 的土豆栽培品种)。

[0450] 因此,术语“农作物”还包括已经借助基因工程方法,例如通过提高潜在产量(例如生物物质、谷粒产量、淀粉、油或蛋白质含量),对于干旱、盐或其他极限环境因素或对害虫以及真菌、细菌和病毒病原体的耐受性而改善生产量的植物。

[0451] 术语“农作物”还包括尤其为了改善人类或动物膳食而借助基因工程方法修饰其成分的植物,例如产生促进健康的长链 ω -3 脂肪酸或单不饱和 ω -9 脂肪酸的油料植物(例如 **Nexera[®]** 油菜)。

[0452] 因此,术语“农作物”还包括已经借助用于改进原料生产的基因工程方法修饰的植物,例如通过增加土豆的支链淀粉含量(**Amflora[®]** 土豆)。

[0453] 此外,已经发现式 I 化合物还适于植物部分的脱叶和/或干燥,对此合适的是农作物如棉花、土豆、油菜、向日葵、大豆或蚕豆,尤其是棉花。就此而言,已经发现用于植物干燥和/或脱叶的组合物、制备这些组合物的方法以及使用式 I 化合物使植物干燥和/或脱叶的方法。

[0454] 作为干燥剂,式 I 化合物特别适于干燥农作物如土豆、油菜、向日葵和大豆以及禾谷类的地面上部分。这使得这些重要农作物的完全机械化收获成为可能。

[0455] 还具有经济益处的是促进柑橘类水果、橄榄以及其他品种的仁果、核果和坚果的收获,这通过在一定时间期限内集中裂开或降低对树的粘附而成为可能。相同的机理,即促进水果部分或叶部分与植物的枝部分之间产生脱离组织对于有用植物,尤其是棉花的易控脱叶也是必要的。

[0456] 此外,各棉花植株成熟的时间间隔缩短导致收获后的纤维质量提高。

[0457] 化合物 I 或包含化合物 I 的除草组合物例如可以以即喷水溶液,粉末,悬浮液以及高度浓缩的水性、油性或其他悬浮液或分散体,乳液,油分散体,糊,粉剂,撒播用材料或颗粒的形式通过喷雾、雾化、撒粉、撒播、浇灌或处理种子或与种子混合而使用。使用形式取决于意欲的目的;在每种情况下都应确保本发明活性成分的最佳可能分布。

[0458] 除草组合物包含除草有效量的至少一种式 I 化合物或 I 的可农用盐和常用于配制作物保护剂的助剂。

[0459] 常用于配作物保护剂的助剂实例是惰性助剂,固体载体,表面活性剂(如分散剂、保护性胶体、乳化剂、润湿剂和增粘剂),有机和无机增稠剂,杀菌剂,防冻剂,消泡剂,合适的话还有着色剂以及用于种子配制剂的粘合剂。

[0460] 增稠剂（即赋予配制剂以改性的流动性能，即静止状态下的高粘度和运动状态下的低粘度的化合物）的实例是多糖，如黄原胶（来自 Kelco 的 **Kelzan**[®]），**Rhodopol**[®] 23 (Rhone Poulenc) 或 **Veegum**[®]（来自 R. T. Vanderbilt），以及有机和无机片状矿物，如 **Attaclay**[®]（来自 Engelhardt）。

[0461] 消泡剂实例是聚硅氧烷乳液（如 **Silikon**[®] SRE, Wacker 或 **Rhodorsil**[®]，来自 Rhodia），长链醇，脂肪酸，脂肪酸盐，有机氟化合物及其混合物。

[0462] 可以加入杀菌剂以稳定含水除草配制剂。杀菌剂实例是基于双氯芬和苄醇半缩甲醛的杀菌剂（ICI 的 **Proxel**[®] 或 Thor Chemie 的 **Acticide**[®] RS 以及 Rohm&Haas 的 **Kathon**[®] MK），还有异噻唑啉酮衍生物，如烷基异噻唑啉酮类和苯并异噻唑啉酮类（Thor Chemie 的 Acticide MBS）。

[0463] 防冻剂实例是乙二醇、丙二醇、脲或甘油。

[0464] 着色剂的实例是微水溶性颜料和水溶性染料。可以提到的实例是以如下名称已知的染料：若丹明 B, C. I. 颜料红 112 和 C. I. 溶剂红 1，以及颜料蓝 15:4，颜料蓝 15:3，颜料蓝 15:2，颜料蓝 15:1，颜料蓝 80，颜料黄 1，颜料黄 13，颜料红 112，颜料红 48:2，颜料红 48:1，颜料红 57:1，颜料红 53:1，颜料橙 43，颜料橙 34，颜料橙 5，颜料绿 36，颜料绿 7，颜料白 6，颜料棕 25，碱性紫 10，碱性紫 49，酸性红 51，酸性红 52，酸性红 14，酸性蓝 9，酸性黄 23，碱性红 10，碱性红 108。

[0465] 粘合剂的实例是聚乙烯吡咯烷酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇和纤基乙酸钠。

[0466] 合适的惰性助剂例如为下列物质：中沸点到高沸点的矿物油馏分如煤油和柴油，此外还有煤焦油和植物或动物来源的油，脂族、环状和芳族烃如石蜡，四氢化萘，烷基化萘及其衍生物，烷基化苯及其衍生物，醇类如甲醇、乙醇、丙醇、丁醇和环己醇，酮类如环己酮或强极性溶剂，例如胺类如 N- 甲基吡咯烷酮，以及水。

[0467] 固体载体为矿土如硅石、硅胶、硅酸盐、滑石、高岭土、石灰石、石灰、白垩、红玄武土、黄土、粘土、白云石、硅藻土、硫酸钙、硫酸镁和氧化镁，磨碎的合成材料，肥料如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵和脲类以及植物来源的产品如谷粉、树皮粉、木粉和坚果壳粉，纤维素粉或其他固体载体。

[0468] 合适的表面活性剂（助剂、润湿剂、增粘剂、分散剂和乳化剂）是芳族磺酸如木素磺酸（例如 Borrespers 类型，Borregaard）、苯酚磺酸、萘磺酸（Morwet 类型，Akzo Nobel）和二丁基萘磺酸（Nekal 类型，BASF SE）以及脂肪酸的碱金属盐、碱土金属盐和铵盐，烷基-和烷基芳基磺酸盐，烷基硫酸盐，月桂基醚硫酸盐和脂肪醇硫酸盐，以及硫酸化十六-、十七-和十八烷醇的盐，还有脂肪醇乙二醇醚的盐，磺化萘及其衍生物与甲醛的缩合物，萘或萘磺酸与苯酚和甲醛的缩合物，聚氧乙烯辛基酚醚，乙氧基化异辛基-、辛基-或壬基酚，烷基苯基或三丁基苯基聚乙二醇醚，烷基芳基聚醚醇，异十三烷醇，脂肪醇 / 氧化乙烯缩合物，乙氧基化蓖麻油，聚氧乙烯烷基醚或聚氧丙烯烷基醚，月桂醇聚乙二醇醚乙酸酯，山梨糖醇酯，木素亚硫酸盐废液和蛋白质，变性蛋白质，多糖（如甲基纤维素），疏水改性的淀粉，聚乙烯醇（Mowiol 类型，Clariant），聚羧酸盐类（BASF SE, Sokalan 类型），聚烷氧基化

物,聚乙烯胺 (BASF SE, Lupamine 类型),聚乙烯亚胺 (BASF SE, Lupasol 类型),聚乙烯基吡咯烷酮及其共聚物。

[0469] 粉末、撒播材料和粉剂可以通过将活性成分与固体载体混合或研磨来制备。

[0470] 颗粒如包衣颗粒、浸渍颗粒和均质颗粒可以通过使活性成分与固体载体粘附而制备。

[0471] 含水使用形式可以通过添加水由乳液浓缩物、悬浮液、糊、可湿性粉末或水分散性颗粒制备。为了制备乳液、糊或油分散体,可以借助湿润剂、增粘剂、分散剂或乳化剂将式 I 或 Ia 化合物直接或溶于油或溶剂之后在水中均化。或者还可以制备包含活性物质、湿润剂、增粘剂、分散剂或乳化剂以及需要的话,溶剂或油的浓缩物,该类浓缩物适于用水稀释。

[0472] 式 I 化合物在即用制剂中的浓度可以在宽范围内变化。配制剂通常包含 0.001-98 重量%,优选 0.01-95 重量%至少一种活性化合物。活性化合物以 90-100%,优选 95-100% (根据 NMR 光谱) 的纯度使用。

[0473] 配制剂或即用制剂还可以包含酸、碱或缓冲剂体系,合适的实例是磷酸或硫酸,或尿素或氨。

[0474] 本发明化合物 I 例如可以按如下配制:

[0475] 1. 用水稀释的产品

[0476] A 水溶性浓缩物

[0477] 将 10 重量份活性化合物溶于 90 重量份水或水溶性溶剂中。或者,加入湿润剂或其他助剂。活性化合物经水稀释溶解。这得到活性化合物含量为 10 重量%的配制剂。

[0478] B 分散性浓缩物

[0479] 将 20 重量份活性化合物溶于 70 重量份环己酮中并加入 10 重量份分散剂如聚乙烯基吡咯烷酮。用水稀释得到分散体。活性化合物含量为 20 重量%。

[0480] C 可乳化浓缩物

[0481] 将 15 重量份活性化合物溶于 75 重量份有机溶剂(如烷基芳烃)中并加入十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物(在每种情况下为 5 重量份)。用水稀释得到乳液。该配制剂的活性化合物含量为 15 重量%。

[0482] D 乳液

[0483] 将 25 重量份活性化合物溶于 35 重量份有机溶剂(如烷基芳烃)中并加入十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物(在每种情况下为 5 重量份)。借助乳化机(Ultraturrax)将该混合物引入 30 重量份水中并制成均相乳液。用水稀释得到乳液。该配制剂的活性化合物含量为 25 重量%。

[0484] E 悬浮液

[0485] 在搅拌的球磨机中,将 20 重量份活性化合物粉碎并加入 10 重量份分散剂和湿润剂以及 70 重量份水或有机溶剂,得到细碎活性化合物悬浮液。用水稀释得到稳定的活性化合物悬浮液。该配制剂中活性化合物含量为 20 重量%。

[0486] F 水分散性颗粒和水溶性颗粒

[0487] 将 50 重量份活性化合物细碎研磨并加入 50 重量份分散剂和湿润剂,借助工业装置(如挤出机、喷雾塔、流化床)将其制成水分散性或水溶性颗粒。用水稀释得到稳定的活性化合物分散体或溶液。该配制剂的活性化合物含量为 50 重量%。

[0488] G 水分散性粉末和水溶性粉末

[0489] 将 75 重量份活性化合物在转子-定子磨机中研磨并加入 25 重量份分散剂、湿润剂和硅胶。用水稀释得到稳定的活性化合物分散体或溶液。该配制剂的活性化合物含量为 75 重量%。

[0490] H 凝胶配制剂

[0491] 在球磨机中研磨 20 重量份活性化合物、10 重量份分散剂、1 重量份胶凝剂和 70 重量份水或有机溶剂,得到细悬浮液。用水稀释得到活性化合物含量为 20 重量%的稳定悬浮液。

[0492] 2. 不经稀释而施用的产品

[0493] I 粉剂

[0494] 将 5 重量份活性化合物细碎研磨并与 95 重量份细碎高岭土充分混合。这得到活性化合物含量为 5 重量%的撒粉粉末。

[0495] J 颗粒 (GR, FG, GG, MG)

[0496] 将 0.5 重量份活性化合物细碎研磨并结合 99.5 重量份载体。现行方法是挤出、喷雾干燥或流化床方法。这得到不经稀释而施用的活性化合物含量为 0.5 重量%的颗粒。

[0497] K ULV 溶液 (UL)

[0498] 将 10 重量份活性化合物溶于 90 重量份有机溶剂如二甲苯中。这得到不经稀释而施用的活性化合物含量为 10 重量%的产品。

[0499] 化合物 I 或包含它们的除草组合物可以出苗前或出苗后施用,或者与农作物的种子一起施用。还可以通过施用被除草组合物或活性化合物预处理的农作物的种子而施用除草组合物或活性化合物。若活性化合物不能被某些农作物良好地耐受,则可以使用其中借助喷雾设备喷雾除草组合物以使它们尽可能不接触敏感农作物的叶子,而活性成分到达生长在下面的不希望的植物的叶子或裸露的土壤表面的施用技术(后引导,最后耕作程序)。

[0500] 在另一实施方案中,可以通过处理种子而施用式 I 化合物或其除草组合物。

[0501] 种子的处理基本包括所有本领域熟练技术人员熟知的基于本发明式 I 化合物或由其制备的组合物的程序(拌种、种子包衣、种子撒粉、种子浸泡、种子包膜、种子多层包衣、种子包壳、种子浸滴和种子造粒)。这里可以加以稀释或不加稀释地施用除草组合物。

[0502] 术语种子包括所有类型的种子,如谷粒、种子、果实、块茎、插条和类似形式。这里优选术语种子描述的是谷粒和种子。

[0503] 所用种子可以是上述有用植物的种子,但还可以是转基因植物或通过常规育种方法得到的植物的种子。

[0504] 活性化合物的施用率为 0.001-3.0kg/ha, 优选 0.01-1.0kg/ha 活性物质(a. s.), 取决于防治目标、季节、目标植物和生长阶段。为了处理种子,化合物 I 通常以 0.001-10kg/100kg 种子的量使用。

[0505] 还可能有利的是将式 I 化合物与安全剂组合使用。安全剂是防止或降低对有用植物的损害而不显著影响式 I 化合物对不希望的植物的除草作用的化合物。它们可以在播种之前(例如在种子处理中或在插条或秧苗上)和有用植物出苗之前或之后使用。安全剂和式 I 化合物可以同时或依次使用。合适的安全剂例如为(喹啉-8-氧基)乙酸、1-苯基-5-卤代烷基-1H-1,2,4-三唑-3-羧酸、1-苯基-4,5-二氢-5-烷基-1H-吡唑-3,5-二

羧酸、4,5-二氢-5,5-二芳基-3-异噁唑羧酸、二氯乙酰胺类、 α -肟基苯基乙腈类、苯乙酮肟类、4,6-二卤代-2-苯基嘧啶、N-[[4-(氨基羰基)苯基]磺酰基]-2-苯甲酰胺、1,8-萘二甲酸酐、2-卤代-4-卤代烷基-5-噁唑羧酸、硫代磷酸酯类和O-苯基N-烷基氨基甲酸酯及其可农用盐,以及它们的可农用衍生物如酰胺、酯和硫酯,条件是它们具有酸官能团。

[0506] 为了拓宽活性谱并获得协同增效效果,可以将式I化合物与大量其他除草或生长调节活性化合物的代表或安全剂混合并联合施用。合适的混合配对例如为1,2,4-噁二唑类,1,3,4-噁二唑类,酰胺类,氨基磷酸及其衍生物,氨基三唑类,酰替苯胺类,芳氧基/杂芳氧基链烷酸及其衍生物,苯甲酸及其衍生物,苯并噁二嗪酮类,2-杂芳酰基/芳酰基-1,3-环己烷二酮类,杂芳基芳基酮类,苄基异噁唑烷酮类,间-CF₃-苯基衍生物,氨基甲酸酯类,喹啉羧酸及其衍生物,氯代乙酰苯胺类,环己酮肟醚衍生物,二嗪类,二氯丙酸及其衍生物,二氢苯并呋喃类,二氢呋喃-3-酮类,二硝基苯胺类,二硝基苯酚类,二苯基醚类,联吡啶类,卤代羧酸及其衍生物,脲类,3-苯基尿嘧啶类,咪唑类,咪唑啉酮类,N-苯基-3,4,5,6-四氢邻苯二甲酰亚胺类,噁二唑类,环氧乙烷类,酚类,芳氧基-和杂芳氧基苯氧基丙酸酯,苯基乙酸及其衍生物,2-苯基丙酸及其衍生物,吡唑类,苯基吡唑类,哒嗪类,吡啶羧酸及其衍生物,嘧啶基醚类,磺酰胺类,磺酰脲类,三嗪类,三嗪酮类,三唑啉酮类,三唑羧酰胺,尿嘧啶类,以及还有苯基吡唑啉类和异噁唑啉类及其衍生物。

[0507] 此外,可能有用的是单独或与其他除草剂组合施用化合物I,或者还可以与其他作物保护试剂混合而联合施用化合物I,例如与用于防治害虫或植物病原性真菌或细菌的组合物联合施用化合物I。还令人感兴趣的是与无机盐溶液的溶混性,所述盐溶液用于缓解营养和微量元素缺乏。还可以加入其他添加剂如非植物毒性油和油浓缩物。

[0508] 可以与本发明式I的吡啶化合物组合使用的除草剂实例为:

[0509] b1) 选自如下的类脂生物合成抑制剂:枯杀达(alloxydim)、枯杀达(alloxydim-sodium)、丁氧环酮(butroxydim)、烯草酮(clethodim)、炔草酯(clodinafop)、炔草酯(clodinafop-propargyl)、噁草酮(cycloxydim)、氰氟草酯(cyhalofop)、氰氟草酯(cyhalofop-butyl)、氯甲草(diclofop)、禾草灵(diclofop-methyl)、噁唑禾草灵(fenoxaprop)、噁唑禾草灵(fenoxaprop-ethyl)、高噁唑禾草灵(fenoxaprop-P)、高噁唑禾草灵(fenoxaprop-P-ethyl)、吡氟禾草灵(fluzifop)、吡氟禾草灵(fluzifop-butyl)、精吡氟禾草灵(fluzifop-P)、精吡氟禾草灵(fluzifop-P-butyl)、吡氟氯禾灵(haloxyfop)、吡氟氯禾灵(haloxyfop-methyl)、精吡氟氯禾灵(haloxyfop-P)、精吡氟氯禾灵(haloxyfop-P-methyl)、噁唑酰草胺(metamifop)、唑啉草酯(pinoxaden)、环苯草酮(profoxydim)、啞草酯(propaquizafop)、喹禾灵(quizalofop)、喹禾灵(quizalofop-ethyl)、喹禾灵(四氢糠基酯)(quizalofop-tefuryl)、精喹禾灵(quizalofop-P)、精喹禾灵(quizalofop-P-ethyl)、精喹禾灵(四氢糠基酯)(quizalofop-P-tefuryl)、稀禾定(sethoxydim)、酞肟草(tepraloxym)、肟草酮(tralkoxydim)、呋草黄(benfuresate)、苏达灭(butylate)、草灭特(cycloate)、茅草枯(dalapon)、哌草丹(dimepiperate)、扑草灭(EPTC)、禾草畏

(esprocarb)、乙呋草黄 (ethofumesate)、四氟丙酸 (flupropanate)、草达灭 (molinate)、坪草丹 (orbencarb)、克草猛 (pebulate)、苜草丹 (prosulfocarb)、TCA、杀草丹 (thiobencarb)、丁草威 (tiocarbazil)、野麦畏 (triallate) 和灭草猛 (vernolate) ;

[0510] b2) 选自如下的 ALS 抑制剂: 磺氨黄隆 (amidosulfuron)、四唑黄隆 (azimsulfuron)、苄嘧黄隆 (bensulfuron)、苄嘧黄隆 (bensulfuron-methyl)、双嘧苯甲酸 (bispribac)、双嘧苯甲酸钠 (bispribac-sodium)、氯嘧黄隆 (chlorimuron)、氯嘧黄隆 (chlorimuron-ethyl)、绿黄隆 (chlorsulfuron)、醚黄隆 (cinosulfuron)、唑嘧磺胺酸 (cloransulam)、唑嘧磺胺盐 (cloransulam-methyl)、环丙黄隆 (cyclosulfamuron)、唑嘧磺胺 (diclosulam)、胺苯黄隆 (ethametsulfuron)、胺苯黄隆 (ethametsulfuron-methyl)、乙氧嘧黄隆 (ethoxysulfuron)、啶嘧黄隆 (flazasulfuron)、双氟磺草胺 (florasulam)、氟酮磺隆 (flucarbazone)、氟酮磺隆钠 (flucarbazone-sodium)、氟吡磺隆 (flucetosulfuron)、氟唑啉草 (flumetsulam)、氟定黄隆 (flupyrsulfuron)、氟定黄隆 (flupyrsulfuron-methyl-sodium)、甲酰氨磺隆 (foramsulfuron)、吡氯黄隆 (halosulfuron)、吡氯黄隆 (halosulfuron-methyl)、咪草酯 (imazamethabenz)、咪草酯 (imazamethabenz-methyl)、咪草啉酸 (imazamox)、甲基咪草烟 (imazapic)、灭草烟 (imazapyr)、灭草啉 (imazaquin)、咪草烟 (imazethapyr)、啶咪黄隆 (imazosulfuron)、碘黄隆 (iodosulfuron)、碘甲黄隆钠 (iodosulfuron-methyl-sodium)、甲基二磺隆 (mesosulfuron)、唑草磺胺 (metosulam)、甲黄隆 (metsulfuron)、甲黄隆 (metsulfuron-methyl)、烟嘧黄隆 (nicosulfuron)、嘧苯胺磺隆 (orthosulfamuron)、环丙氧黄隆 (oxasulfuron)、五氟磺草胺 (penoxsulam)、氟嘧黄隆 (primisulfuron)、氟嘧黄隆 (primisulfuron-methyl)、丙苯磺隆 (propoxycarbazine)、丙苯磺隆 (propoxycarbazine-sodium)、氟丙黄隆 (prosulfuron)、吡嘧黄隆 (pyrazosulfuron)、吡嘧黄隆 (pyrazosulfuron-ethyl)、嘧啉肟草醚 (pyribenzoxim)、pyrimisulfan、环酯草醚 (pyriftalid)、肟啉草 (pyriminobac)、肟啉草 (pyriminobac-methyl)、嘧硫苯甲酸 (pyrithiobac)、嘧硫苯甲酸钠 (pyrithiobac-sodium)、啶磺草胺 (pyroxsulam)、玉嘧黄隆 (rimsulfuron)、嘧黄隆 (sulfometuron)、嘧黄隆 (sulfometuron-methyl)、乙黄黄隆 (sulfosulfuron)、thiencarbazine、噻酮磺隆 (thiencarbazine-methyl)、噻黄隆 (thifensulfuron)、噻黄隆 (thifensulfuron-methyl)、醚苯黄隆 (triasulfuron)、苯黄隆 (tribenuron)、苯黄隆 (tribenuron-methyl)、三氟啉磺隆 (trifloxysulfuron)、氟胺磺隆 (triflusulfuron)、氟胺磺隆 (triflusulfuron-methyl) 和三氟甲磺隆 (tritosulfuron) ;

[0511] b3) 选自如下的光合成抑制剂: 莠灭净 (ametryn)、胺唑草酮 (amicarbazine)、莠去津 (atrazine)、噻草平 (bentazone)、噻草平 (bentazone-sodium)、除草定 (bromacil)、杀草全 (bromofenoxim)、溴苯腈 (bromoxynil) 及其盐和酯、氯溴隆 (chlorobromuron)、杀草敏 (chloridazone)、绿麦隆 (chlorotoluron)、枯草隆 (chloroxuron)、草净津 (cyanazine)、异苯敌草 (desmedipham)、敌草净 (desmetryn)、丁噁隆 (dimefuron)、戊草津 (dimethametryn)、敌草快阳离子 (diquat)、敌草快 (diquat-dibromide)、敌草隆 (diuron)、伏草隆 (fluometuron)、六嗪同 (hexazinone)、碘苯腈 (ioxynil) 及其盐和酯、异丙隆 (isoproturon)、异恶隆 (isouron)、卡草灵 (karbutilate)、环草定 (lenacil)、利谷隆 (linuron)、苯嗪草 (metamitron)、噻唑隆 (methabenzthiazuron)、色满隆

(metobenzuron)、甲氧隆 (metoxuron)、赛克津 (metribuzin)、绿谷隆 (monolinuron)、草不隆 (neburon)、对草快阳离子 (paraquat)、对草快 (paraquat-dichloride)、对草快 (paraquat-dimetilsulfate)、蔬草灭 (pentanochlor)、苯敌草 (phenmedipham)、乙苯敌草 (phenmedipham-ethyl)、扑灭通 (prometon)、扑草净 (prometryn)、敌稗 (propanil)、扑灭津 (propazine)、pyridafol、达草止 (pyridate)、环草隆 (siduron)、西玛津 (simazine)、西草净 (simetryn)、丁唑隆 (tebuthiuron)、特草定 (terbacil)、甲氧去草净 (terbumeton)、特丁津 (terbuthylazine)、去草净 (terbutryn)、赛二唑素 (thidiazuron) 和草达津 (trietazine) ;

[0512] b4) 选自如下的原卟啉原-IX 氧化酶抑制剂: 氟锁草醚 (acifluorfen)、氟锁草醚 (acifluorfen-sodium)、唑啉炔草 (azafenidin)、bencarbazone、双苯嘧草酮 (benzfendizone)、治草醚 (bifenox)、氟丙嘧草酯 (butafenacil)、氟酮唑草 (carfentrazone)、氟酮唑草 (carfentrazone-ethyl)、氯硝醚 (chlomethoxyfen)、吡啶酮草酯 (cinidon-ethyl)、异丙吡草酯 (fluazolate)、氟吡嗪草酯 (flufenpyr)、氟吡嗪草酯 (flufenpyr-ethyl)、酰亚胺苯氧乙酸 (flumiclorac)、酰亚胺苯氧乙酸戊酯 (flumiclorac-pentyl)、氟噁嗪酮 (flumioxazin)、乙羧氟草醚 (fluoroglycofen)、乙羧氟草醚 (fluoroglycofen-ethyl)、达草氟 (fluthiacet)、达草氟 (fluthiacet-methyl)、氟黄胺草醚 (fomesafen)、氟硝磺酰胺 (halosafen)、乳氟禾草灵 (lactofen)、炔丙噁唑草 (oxadiargyl)、恶草灵 (oxadiazon)、乙氧氟草醚 (oxyfluorfen)、戊噁唑草 (pentoxazone)、氟唑草胺 (profluazol)、双唑草腈 (pyraclonil)、氟唑草酯 (pyraflufen)、氟唑草酯 (pyraflufen-ethyl)、苯嘧磺草胺 (saflufenacil)、磺胺草唑 (sulfentrazone)、噁二唑胺 (thidiazimin)、2-氯-5-[3,6-二氢-3-甲基-2,6-二氧代-4-三氟甲基-1(2H)-嘧啶基]-4-氟-N-[(异丙基)甲基氨基磺酰基]苯甲酰胺 (H-1; CAS372137-35-4)、[3-[2-氯-4-氟-5-(1-甲基-6-三氟甲基-2,4-二氧代-1,2,3,4-四氢嘧啶-3-基)苯氧基]-2-吡啶氧基]乙酸乙酯 (H-2; CAS353292-31-6)、N-乙基-3-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯氧基)-5-甲基-1H-吡唑-1-甲酰胺 (H-3; CAS452098-92-9)、N-四氢糠基-3-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯氧基)-5-甲基-1H-吡唑-1-甲酰胺 (H-4; CAS915396-43-9)、N-乙基-3-(2-氯-6-氟-4-三氟甲基苯氧基)-5-甲基-1H-吡唑-1-甲酰胺 (H-5; CAS452099-05-7)、N-四氢糠基-3-(2-氯-6-氟-4-三氟甲基苯氧基)-5-甲基-1H-吡唑-1-甲酰胺 (H-6; CAS45100-03-7)、3-[7-氟-3-氧代-4-(丙-2-炔基)-3,4-二氢-2H-苯并[1,4]噁嗪-6-基]-1,5-二甲基-6-硫代-[1,3,5]三嗪烷 (triazinan)-2,4-二酮,1,5-二甲基-6-硫代-3-(2,2,7-三氟-3-氧代-4-(丙-2-炔基)-3,4-二氢-2H-苯并[b][1,4]噁嗪-6-基)-1,3,5-三嗪烷-2,4-二酮、2-(2,2,7-三氟-3-氧代-4-丙-2-炔基-3,4-二氢-2H-苯并[1,4]噁嗪-6-基)-4,5,6,7-四氢异吡啶-1,3-二酮和 1-甲基-6-三氟甲基-3-(2,2,7-三氟-3-氧代-4-丙-2-炔基-3,4-二氢-2H-苯并[1,4]噁嗪-6-基)-1H-嘧啶-2,4-二酮;

[0513] b5) 选自如下的漂白剂除草剂: 苯草醚 (aclonifen)、杀草强 (amitrol)、氟丁酰草胺 (beflubutamid)、苯并双环酮 (benzobicyclon)、吡草酮 (benzofenap)、

异恶草酮 (clomazone)、吡氟草胺 (diflufenican)、氟草同 (fluridone)、氟咯草酮 (flurochloridone)、呋草酮 (flurtamone)、异噁氟草 (isoxaflutole)、甲基磺草酮 (mesotrione)、达草灭 (norflurazon)、氟吡酰草胺 (picolinafen)、pyrasulfutole、吡唑特 (pyrazolynate)、苄草唑 (pyrazoxyfen)、磺草酮 (sulcotrione)、特糠酯酮 (tefuryltrione)、环磺酮 (tembotrione)、苯吡唑草酮 (topramezone)、4-羟基-3-[[2-[(2-甲氧基乙氧基)甲基]-6-(三氟甲基)-3-吡啶基]羰基]双环[3.2.1]辛-3-烯-2-酮 (H-7; CAS352010-68-5) 和 4-(3-三氟甲基苯氧基)-2-(4-三氟甲基苯基)嘧啶 (H-8; CAS180608-33-7) ;

[0514] b6) 选自如下的 EPSP 合成酶抑制剂: 草甘膦、草甘膦异丙胺盐 (glyphosate-isopropylammonium) 和草硫膦 (glyphosate-trimesium) (sulfosate) ;

[0515] b7) 选自如下的谷氨酰胺合成酶抑制剂: 双丙氨酰膦 (bilanaphos (bialaphos))、双丙氨酰膦 (bilanaphos-sodium)、草铵膦和草铵膦 (glufosinate-ammonium) ;

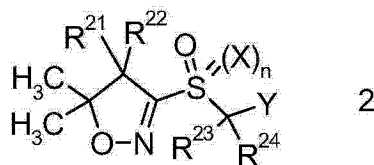
[0516] b8) 选自如下的 DHP 合成酶抑制剂: 黄草灵 (asulam) ;

[0517] b9) 选自如下的有丝分裂抑制剂: 胺草磷 (amiprophos)、甲基胺草磷 (amiprophos-methyl)、氟草胺 (benfluralin)、草胺磷 (butamiphos)、地乐胺 (butralin)、长杀草 (carbetamide)、氯苯胺灵 (chlorpropham)、敌草索 (chlorthal)、敌草索 (chlorthal-dimethyl)、敌乐胺 (dinitramine)、氟硫草定 (dithiopyr)、丁氟消草 (ethalfluralin)、氟消草 (fluchloralin)、黄草消 (oryzalin)、胺硝草 (pendimethalin)、氨基丙氟灵 (prodiamine)、苯胺灵 (propham)、拿草特 (propyzamide)、丙戊草胺 (tebutam)、噻氟啶草 (thiazopyr) 和氟乐灵 (trifluralin) ;

[0518] b10) 选自如下的 VLCFA 抑制剂: 乙草胺 (acetochlor)、甲草胺 (alachlor)、莎稗磷 (anilofos)、丁草胺 (butachlor)、唑草胺 (cafenstrole)、克草胺 (dimethachlor)、噻吩草胺 (dimethanamid)、精噻吩草胺 (dimethenamid-P)、草乃敌 (diphenamid)、四唑酰草胺 (fentrazamide)、氟噻草胺 (flufenacet)、苯噻草胺 (mefenacet)、吡草胺 (metazachlor)、异丙甲草胺 (metolachlor)、S-异丙甲草胺 (metolachlor-S)、萘丙胺 (naproanilide)、草萘胺 (napropamide)、烯草胺 (pethoxamid)、哌草磷 (piperophos)、丙草胺 (pretilachlor)、扑草胺 (propachlor)、异丙草胺 (propisochlor)、派罗克杀草砒 (pyroxasulfone) (KIH-485) 和噻醚草胺 (thenylchlor) ;

[0519] 式 2 化合物:

[0520]



[0521] 其中各变量具有下列含义:

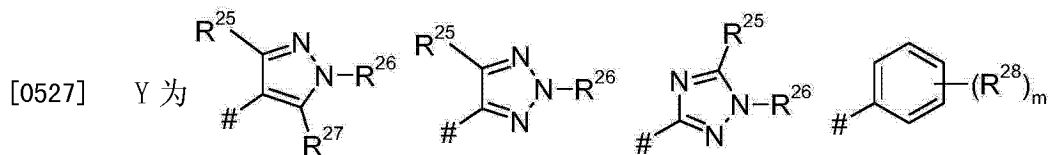
[0522] Y 为苯基或如开头所定义的 5 或 6 员杂芳基, 所述基团可以被 1-3 个基团 R^{aa} 取代;

[0523] R²¹、R²²、R²³、R²⁴ 为 H、卤素或 C₁-C₄ 烷基;

[0524] X 为 O 或 NH;

[0525] n 为 0 或 1。

[0526] 式 2 化合物尤其具有下列含义：



[0528] 其中 # 表示与该分子的骨架的键；以及

[0529] R^{21} 、 R^{22} 、 R^{23} 、 R^{24} 各自为 H、Cl、F 或 CH_3 ；

[0530] R^{25} 为卤素、 C_1 - C_4 烷基或 C_1 - C_4 卤代烷基；

[0531] R^{26} 为 C_1 - C_4 烷基；

[0532] R^{27} 为卤素、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基；

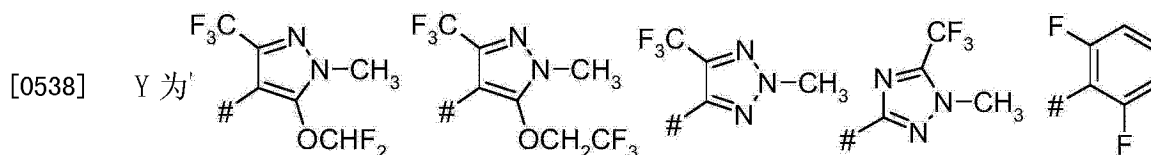
[0533] R^{28} 为 H、卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基；

[0534] m 为 0、1、2 或 3；

[0535] X 为氧；

[0536] n 为 0 或 1。

[0537] 优选的式 2 化合物具有下列含义：



[0539] R^{21} 为 H；

[0540] R^{22} 、 R^{23} 为 F；

[0541] R^{24} 为 H 或 F；

[0542] X 为氧；

[0543] n 为 0 或 1。

[0544] 特别优选的式 2 化合物为 3-[5-(2,2-二氟乙氧基)-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基]甲磺酰基]-4-氟-5,5-二甲基-4,5-二氢异噁唑 (2-1)、3-{[5-(2,2-二氟乙氧基)-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基]氟甲磺酰基}-5,5-二甲基-4,5-二氢异噁唑 (2-2)、4-(4-氟-5,5-二甲基-4,5-二氢异噁唑-3-磺酰基甲基)-2-甲基-5-三氟甲基-2H-[1,2,3]三唑 (2-3)、4-[(5,5-二甲基-4,5-二氢异噁唑-3-磺酰基)氟甲基]-2-甲基-5-三氟甲基-2H-[1,2,3]三唑 (2-4)、4-(5,5-二甲基-4,5-二氢异噁唑-3-磺酰基甲基)-2-甲基-5-三氟甲基-2H-[1,2,3]三唑 (2-5)、3-{[5-(2,2-二氟乙氧基)-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基]二氟甲磺酰基}-5,5-二甲基-4,5-二氢异噁唑 (2-6)、4-[(5,5-二甲基-4,5-二氢异噁唑-3-磺酰基)二氟甲基]-2-甲基-5-三氟甲基-2H-[1,2,3]三唑 (2-7)、3-{[5-(2,2-二氟乙氧基)-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基]二氟甲磺酰基}-4-氟-5,5-二甲基-4,5-二氢异噁唑 (2-8)、4-[二氟-(4-氟-5,5-二甲基-4,5-二氢异噁唑-3-磺酰基)甲基]-2-甲基-5-三氟甲

基-2H-[1, 2, 3] 三唑 (2-9) ;

[0545] b11) 选自如下的纤维素生物合成抑制剂:草克乐 (chlorthiamid)、敌草腈 (dichlobenil)、胺草唑 (flupoxam) 和异恶草胺 (isoxaben) ;

[0546] b12) 选自如下的分离剂除草剂:地乐酚 (dinoseb)、地乐消酚 (dinoterb) 以及二硝甲酚 (DNOC) 及其盐;

[0547] b13) 选自如下的植物生长素除草剂:2, 4-D 及其盐和酯、2, 4-DB 及其盐和酯、氨草啶 (aminopyralid) 及其盐如氨草啶铵盐 (aminopyralid-tris(2-hydroxypropyl) ammonium) 和其酯、草除灵 (benazolin)、草除灵 (benazolin-ethyl)、草灭平 (chloramben) 及其盐和酯、稗草胺 (clomeprop)、二氯皮考啉酸 (clopyralid) 及其盐和酯、麦草畏 (dicamba) 及其盐和酯、2, 4-滴丙酸 (dichlorprop) 及其盐和酯、高 2, 4-滴丙酸 (dichlorprop-P) 及其盐和酯、氟草烟 (fluroxypyr)、氟草烟 (fluroxypyr-butometyl)、氟氯胺啶 (fluroxypyr-meptyl)、MCPA 及其盐和酯、2 甲 4 氯乙硫酯 (MCPA-thioethyl)、MCPB 及其盐和酯、2 甲 4 氯丙酸 (mecoprop) 及其盐和酯、高 2 甲 4 氯丙酸 (mecoprop-P) 及其盐和酯、毒莠定 (picloram) 及其盐和酯、二氯喹啉酸 (quinclorac)、喹草酸 (quinmerac)、TBA (2, 3, 6) 及其盐和酯、绿草定 (triclopyr) 及其盐和酯以及 5, 6-二氯-2-环丙基-4-噻啶甲酸 (H-9 ;CAS858956-08-8) 及其盐和酯;

[0548] b14) 选自如下的植物生长素输送抑制剂:二氟吡隆 (diflufenzopyr)、二氟吡隆 (diflufenzopyr-sodium)、抑草生 (naptalam) 和抑草生 (naptalam-sodium) ;

[0549] b15) 选自如下的其他除草剂:溴丁酰草胺 (bromobutide)、氯甲丹 (chlorflurenol)、氯甲丹 (chlorflurenol-methyl)、环庚草醚 (cinmethylin)、苣草隆 (cumyluron)、茅草枯、棉隆 (dazomet)、苯敌快 (difenzoquat)、苯敌快 (difenzoquat-metilsulfate)、噻节因 (dimethipin)、甲肿钠 (DSMA)、香草隆 (dymron)、敌草腈 (endothal) 及其盐、乙苯酰草 (etobenzanid)、氟燕灵 (flamprop)、氟燕灵 (flamprop-isopropyl)、甲氟燕灵 (flamprop-methyl)、强氟燕灵 (flamprop-M-isopropyl)、麦草伏 (flamprop-M-methyl)、抑草丁 (flurenol)、抑草丁 (flurenol-butyl)、调噻醇 (flurprimidol)、膦胺素 (fosamine)、膦胺素 (fosamine-ammonium)、茛草酮 (indanofan)、抑芽丹 (maleic hydra-zide)、氟草磺 (mefluidide)、威百亩 (metam)、叠氮甲烷 (methyl azide)、溴甲烷 (methyl bromide)、苯丙隆 (methyl-dymron)、碘甲烷 (methyl iodide)、甲肿一钠 (MSMA)、油酸 (oleic acid)、氯噁嗪草 (oxaziclomefone)、壬酸 (pelargonic acid)、稗草畏 (pyributicarb)、灭藻醌 (quinoclamine)、苯氧丙胺津 (triaziflam)、灭草环 (tridiphane) 和 6-氯-3-(2-环丙基-6-甲基苯氧基)-4-吡嗪醇 (H-10 ;CAS499223-49-3) 及其盐和酯。

[0550] 优选安全剂 C 的实例为解草酮 (benoxacor)、喹氧乙酸 (cloquintocet)、抑害腈 (cyometrinil)、环丙磺酰胺 (cyprosulfamide)、抑害胺 (dichlormid)、dicyclonone、增效磷 (dietholate)、解草唑 (fenchlorazole)、解草啶 (fencloirim)、解草安 (flurazole)、肼草安 (fluxofenim)、解草呋 (furilazole)、双苯噁唑酸 (isoxadifen)、吡咯二酸 (mefenpyr)、甲基氨基甲酸 4-氯苯基酯 (mephenate)、萘二甲酸酐 (naphthalic anhydride)、解草腈 (oxabetrinil)、4-(二氯乙酰基)-1-氧杂-4-氮杂螺 [4.5] 癸烷

(H-11 ;MON4660, CAS71526-07-3) 和 2, 2, 5- 三甲基 -3-(二氯乙酰基)-1, 3- 噁唑烷 (H-12 ; R-29148, CAS52836-31-4)。

[0551] b1)-b15) 组活性化合物和安全剂 C 是已知的除草剂和安全剂, 例如参见 The Compendium of Pesticide Common Names (<http://www.alanwood.net/pesticides/>) ; B. Hock, C. Fedtke, R. R. Schmidt, Herbicide [除草剂], Georg Thieme Verlag, Stuttgart, 1995。其他除草活性化合物由 W096/26202、W097/41116、W097/41117、W097/41118、W001/83459 和 W02008/074991, W. **Krämer** 等 (编辑) "Modern Crop Protection Compounds", 第 1 卷, Wiley VCH, 2007 以及其中引用的文献已知。

[0552] 本发明还涉及配制成单组分组合物的作物保护组合物形式的组合物, 所述单组分组合物包含含有至少一种式 I 的吡啶化合物和至少一种优选选自 b1-b15 组活性化合物的其他活性化合物的活性化合物组合以及至少一种固体或液体载体和 / 或一种或多种表面活性剂和需要的话一种或多种其他常用于作物保护组合物的助剂。

[0553] 本发明还涉及配制成双组分组合物的作物保护组合物形式的组合物, 所述双组分组合物包含含有至少一种式 I 的化合物、固体或液体载体和 / 或一种或多种表面活性剂的第一组分和含有至少一种选自 b1-b15 组活性化合物的其他活性化合物、固体或液体载体和 / 或一种或多种表面活性剂的第二组分, 其中这两种组分还可以额外包含其他常用于作物保护组合物的助剂。

[0554] 在包含至少一种式 I 化合物作为组分 A 和至少一种除草剂 B 的二元组合物中, 活性化合物 A:B 的重量比通常为 1:1000-1000:1, 优选 1:500-500:1, 尤其是 1:250-250:1, 特别优选 1:75-75:1。

[0555] 在包含至少一种式 I 化合物作为组分 A 和至少一种安全剂 C 的二元组合物中, 活性化合物 A:C 的重量比通常为 1:1000-1000:1, 优选 1:500-500:1, 尤其是 1:250-250:1, 特别优选 1:75-75:1。

[0556] 在包含至少一种式 I 化合物作为组分 A、至少一种除草剂 B 和至少一种安全剂 C 的三元组合物中, 组分 A:B 的相对重量份数通常为 1:1000-1000:1, 优选 1:500-500:1, 尤其是 1:250-250:1, 特别优选 1:75-75:1 ; 组分 A:C 的重量比通常为 1:1000-1000:1, 优选 1:500-500:1, 尤其是 1:250-250:1, 特别优选 1:75-75:1 ; 且组分 B:C 的重量比通常为 1:1000-1000:1, 优选 1:500-500:1, 尤其是 1:250-250:1, 特别优选 1:75-75:1。优选组分 A+B 与组分 C 的重量比为 1:500-500:1, 尤其是 1:250-250:1, 特别优选 1:75-75:1。

[0557] 在每种情况下包含一种单独式 I 化合物和一种混合配对或混合配对组合的本发明特别优选组合物的实例在下表 B 中给出。

[0558] 本发明的另一方面涉及下表 B 中所列组合物 B-1 至 B-1236, 其中在每种情况下表 B 的一行对应于包含在上述说明中列举的式 I 化合物之一 (组分 1) 和在每种情况下在所述行中所述的选自 b1)-b15) 组的其他活性化合物和 / 或安全剂 C (组分 2) 的除草组合物。所述组合物中的活性化合物在每种情况下优选以协同增效有效量存在。

[0559] 表 B :

[0560]

	除草剂B	安全剂C
B-1	炔草酯	--
B-2	噻草酮	--
B-3	氟氟草酯	--
B-4	高噁唑禾草灵	--
B-5	唑啉草酯	--
B-6	环苯草酮	--
B-7	酞肟草	--
B-8	肟草酮	--
B-9	禾草畏	--
B-10	苄草丹	--
B-11	杀草丹	--
B-12	野麦畏	--
B-13	苄嘧黄隆	--
B-14	双嘧苯甲酸钠	--
B-15	环丙黄隆	--
B-16	氟唑啉草	--
B-17	氟定黄隆	--
B-18	甲酰氟磺隆	--
B-19	咪草啶酸	--
B-20	甲基咪草烟	--
B-21	灭草烟	--
B-22	灭草嗪	--
B-23	咪草烟	--
B-24	啶咪黄隆	--
B-25	碘甲黄隆钠	--
B-26	甲基二磺隆	--
B-27	烟嘧黄隆	--
B-28	五氟磺草胺	--

[0561]

	除草剂B	安全剂C
B-29	丙苯磺隆	--
B-30	吡嘧黄隆	--
B-31	啶磺草胺	--
B-32	玉嘧黄隆	--
B-33	乙黄黄隆	--
B-34	噻酮磺隆	--
B-35	三氟甲磺隆	--
B-36	2,4-D及其盐和酯	--
B-37	氨草啶及其盐和酯	--
B-38	二氯皮考啉酸及其盐和酯	--
B-39	麦草畏及其盐和酯	--
B-40	氟氯胺啶	--
B-41	二氯喹啉酸	--
B-42	喹草酸	--
B-43	H-9	--
B-44	二氟吡隆	--
B-45	二氟吡隆	--
B-46	异恶草酮	--
B-47	吡氟草胺	--
B-48	氟咯草酮	--
B-49	异恶氟草	--
B-50	甲基磺草酮	--
B-51	氟吡酰草胺	--
B-52	磺草酮	--
B-53	特糠酯酮	--
B-54	环磺酮	--
B-55	苯吡唑草酮	--
B-56	H-7	--
B-57	莠去津	--
B-58	敌草隆	--
B-59	伏草隆	--
B-60	六嗪同	--
B-61	异丙隆	--
B-62	赛克津	--
B-63	敌稗	--
B-64	特丁津	--

[0562]

	除草剂B	安全剂C
B-65	对草快	--
B-66	氟噁嗪酮	--
B-67	乙氧氟草醚	--
B-68	嘧啶肟草醚	--
B-69	磺胺草唑	--
B-70	H-1	--
B-71	H-2	--
B-72	草甘膦	--
B-73	草甘膦异丙胺盐	--
B-74	草硫膦	--
B-75	草铵膦	--
B-76	草铵膦	--
B-77	胺硝草	--
B-78	氟乐灵	--
B-79	乙草胺	--
B-80	唑草胺	--
B-81	精噻吩草胺	--
B-82	四唑酰草胺	--
B-83	氟噻草胺	--
B-84	苯噻草胺	--
B-85	吡草胺	--
B-86	S-异丙甲草胺	--
B-87	派罗克杀草砒	--
B-88	异恶草胺	--
B-89	香草隆	--
B-90	茚草酮	--
B-91	氟噁嗪草	--
B-92	苯氧丙胺津	--
B-93	绿麦隆	--
B-94	莠去津+ H-1	--
B-95	莠去津+草甘膦	--
B-96	莠去津+甲基磺草酮	--
B-97	莠去津+烟嘧黄隆	--
B-98	莠去津+ 环磺酮	--
B-99	莠去津+ 苯吡唑草酮	--
B-100	异恶草酮+草甘膦	--

[0563]

	除草剂B	安全剂C
B-101	炔草酯	--
B-102	吡氟草胺+高噁唑禾草灵	--
B-103	吡氟草胺+氟定黄隆	--
B-104	吡氟草胺+草甘膦	--
B-105	吡氟草胺+甲基二磺隆(甲基二磺隆)	--
B-106	吡氟草胺+唑啞草酯	--
B-107	吡氟草胺+啶磺草胺	--
B-108	氟唑啞草+草甘膦	--
B-109	氟噁嗪酮+草甘膦	--
B-110	甲基咪草烟+草甘膦	--
B-111	咪草烟+草甘膦	--
B-112	异噁氟草+ H-1	--
B-113	异噁氟草+草甘膦	--
B-114	吡草胺+ H-1	--
B-115	吡草胺+草甘膦	--
B-116	吡草胺+甲基磺草酮	--
B-117	吡草胺+烟嘧黄隆	--
B-118	吡草胺+特丁津	--
B-119	吡草胺+ 苯吡唑草酮	--
B-120	赛克津+草甘膦	--
B-121	胺硝草+ H-1	--
B-122	胺硝草+炔草酯	--
B-123	胺硝草+高噁唑禾草灵	--
B-124	胺硝草+氟定黄隆	--
B-125	胺硝草+草甘膦	--
B-126	胺硝草+甲基二磺隆	--
B-127	胺硝草+甲基磺草酮	--
B-128	胺硝草+烟嘧黄隆	--
B-129	胺硝草+唑啞草酯	--
B-130	胺硝草+啶磺草胺	--
B-131	胺硝草+ 环磺酮	--
B-132	胺硝草+ 苯吡唑草酮	--
B-133	派罗克杀草砒+ 环磺酮	--
B-134	派罗克杀草砒+ 苯吡唑草酮	--
B-135	磺胺草唑+草甘膦	--
B-136	特丁津+ H-1	--

[0564]

	除草剂B	安全剂C
B-137	特丁津+甲酰氨基磺隆	--
B-138	特丁津+草甘膦	--
B-139	特丁津+甲基磺草酮	--
B-140	特丁津+烟嘧磺隆	--
B-141	特丁津+环磺酮	--
B-142	特丁津+苯吡唑草酮	--
B-143	氟乐灵+草甘膦	--
B-144	--	解草酮
B-145	--	喹氧乙酸
B-146	--	环丙磺酰胺
B-147	--	抑害胺
B-148	--	解草唑
B-149	--	双苯噁唑酸
B-150	--	吡咯二酸
B-151	--	H-11
B-152	--	H-12
B-153	炔草酯	解草酮
B-154	噻草酮	解草酮
B-155	氟氟草酯	解草酮
B-156	高噁唑禾草灵	解草酮
B-157	唑啉草酯	解草酮
B-158	环苯草酮	解草酮
B-159	酞肟草	解草酮
B-160	肟草酮	解草酮
B-161	禾草畏	解草酮
B-162	苄草丹	解草酮
B-163	杀草丹	解草酮
B-164	野麦畏	解草酮
B-165	苄嘧磺隆	解草酮
B-166	双嘧苯甲酸钠	解草酮
B-167	环丙磺隆	解草酮
B-168	氟唑啉草	解草酮
B-169	氟定磺隆	解草酮
B-170	甲酰氨基磺隆	解草酮
B-171	咪草啞酸	解草酮
B-172	甲基咪草烟	解草酮

[0565]

	除草剂B	安全剂C
B-173	灭草烟	解草酮
B-174	灭草喹	解草酮
B-175	咪草烟	解草酮
B-176	啉咪黄隆	解草酮
B-177	碘甲黄隆钠	解草酮
B-178	甲基二磺隆	解草酮
B-179	烟嘧黄隆	解草酮
B-180	五氟磺草胺	解草酮
B-181	丙苯磺隆	解草酮
B-182	吡嘧黄隆	解草酮
B-183	啉磺草胺	解草酮
B-184	五氟黄隆	解草酮
B-185	乙黄隆	解草酮
B-186	噻酮磺隆	解草酮
B-187	三氟甲磺隆	解草酮
B-188	2,4-D及其盐和酯	解草酮
B-189	氯草啶及其盐和酯	解草酮
B-190	二氯皮考啉酸及其盐和酯	解草酮
B-191	麦草畏及其盐和酯	解草酮
B-192	氟氯胺啶	解草酮
B-193	二氯喹啉酸	解草酮
B-194	喹草酸	解草酮
B-195	H-9	解草酮
B-196	二氟吡隆	解草酮
B-197	二氟吡隆	解草酮
B-198	异恶草酮	解草酮
B-199	吡氟草胺	解草酮
B-200	氟咯草酮	解草酮
B-201	异恶氟草	解草酮
B-202	甲基磺草酮	解草酮
B-203	氟吡酰草胺	解草酮
B-204	磺草酮	解草酮
B-205	特糠酯酮	解草酮
B-206	环磺酮	解草酮
B-207	苯吡唑草酮	解草酮
B-208	H-7	解草酮

[0566]

	除草剂B	安全剂C
B-209	莠去津	解草酮
B-210	敌草隆	解草酮
B-211	伏草隆	解草酮
B-212	六嗪同	解草酮
B-213	异丙隆	解草酮
B-214	赛克津	解草酮
B-215	敌稗	解草酮
B-216	特丁津	解草酮
B-217	对草快	解草酮
B-218	氟噁嗪酮	解草酮
B-219	乙氧氟草醚	解草酮
B-220	嘧啶𫂇草醚	解草酮
B-221	磺胺草唑	解草酮
B-222	H-1	解草酮
B-223	H-2	解草酮
B-224	草甘膦	解草酮
B-225	草甘膦异丙胺盐	解草酮
B-226	草硫膦	解草酮
B-227	草铵膦	解草酮
B-228	草铵膦	解草酮
B-229	胺硝草	解草酮
B-230	氟乐灵	解草酮
B-231	乙草胺	解草酮
B-232	唑草胺	解草酮
B-233	精噻吩草胺	解草酮
B-234	四唑酰草胺	解草酮
B-235	氟噻草胺	解草酮
B-236	苯噻草胺	解草酮
B-237	吡草胺	解草酮
B-238	S-异丙甲草胺	解草酮
B-239	派罗克杀草砒	解草酮
B-240	异恶草胺	解草酮
B-241	香草隆	解草酮
B-242	茚草酮	解草酮
B-243	氟噁嗪草	解草酮
B-244	苯氧丙胺津	解草酮

[0567]

	除草剂B	安全剂C
B-245	莠去津+ H-1	解草酮
B-246	莠去津+草甘膦	解草酮
B-247	莠去津+甲基磺草酮	解草酮
B-248	莠去津+烟嘧黄隆	解草酮
B-249	莠去津+ 环磺酮	解草酮
B-250	莠去津+ 苯吡唑草酮	解草酮
B-251	异恶草酮+草甘膦	解草酮
B-252	吡氟草胺+炔草酯	解草酮
B-253	吡氟草胺+高噁唑禾草灵	解草酮
B-254	吡氟草胺+氟定黄隆	解草酮
B-255	吡氟草胺+草甘膦	解草酮
B-256	吡氟草胺+甲基二磺隆	解草酮
B-257	吡氟草胺+唑啞草酯	解草酮
B-258	吡氟草胺+啶磺草胺	解草酮
B-259	氟唑啞草+草甘膦	解草酮
B-260	氟噁嗪酮+草甘膦	解草酮
B-261	甲基咪草烟+草甘膦	解草酮
B-262	咪草烟+草甘膦	解草酮
B-263	异噁氟草+ H-1	解草酮
B-264	异噁氟草+草甘膦	解草酮
B-265	吡草胺+ H-1	解草酮
B-266	吡草胺+草甘膦	解草酮
B-267	吡草胺+甲基磺草酮	解草酮
B-268	吡草胺+烟嘧黄隆	解草酮
B-269	吡草胺+特丁津	解草酮
B-270	吡草胺+ 苯吡唑草酮	解草酮
B-271	赛克津+草甘膦	解草酮
B-272	胺硝草+ H-1	解草酮
B-273	胺硝草+炔草酯	解草酮
B-274	胺硝草+高噁唑禾草灵	解草酮
B-275	胺硝草+氟定黄隆	解草酮
B-276	胺硝草+草甘膦	解草酮
B-277	胺硝草+甲基二磺隆	解草酮
B-278	胺硝草+甲基磺草酮	解草酮
B-279	胺硝草+烟嘧黄隆	解草酮
B-280	胺硝草+唑啞草酯	解草酮

[0568]

	除草剂B	安全剂C
B-281	胺硝草+啶磺草胺	解草酮
B-282	胺硝草+环磺酮	解草酮
B-283	胺硝草+苯吡唑草酮	解草酮
B-284	派罗克杀草砒+环磺酮	解草酮
B-285	派罗克杀草砒+苯吡唑草酮	解草酮
B-286	磺胺草唑+草甘膦	解草酮
B-287	特丁津+H-1	解草酮
B-288	特丁津+甲酰氨磺隆	解草酮
B-289	特丁津+草甘膦	解草酮
B-290	特丁津+甲基磺草酮	解草酮
B-291	特丁津+烟嘧黄隆	解草酮
B-292	特丁津+环磺酮	解草酮
B-293	特丁津+苯吡唑草酮	解草酮
B-294	氟乐灵+草甘膦	解草酮
B-295	炔草酯	喹氧乙酸
B-296	噻草酮	喹氧乙酸
B-297	氟氟草酯	喹氧乙酸
B-298	高噁唑禾草灵	喹氧乙酸
B-299	唑啞草酯	喹氧乙酸
B-300	环苯草酮	喹氧乙酸
B-301	酞肟草	喹氧乙酸
B-302	肟草酮	喹氧乙酸
B-303	禾草畏	喹氧乙酸
B-304	苄草丹	喹氧乙酸
B-305	杀草丹	喹氧乙酸
B-306	野麦畏	喹氧乙酸
B-307	苄嘧黄隆	喹氧乙酸
B-308	双嘧苯甲酸钠	喹氧乙酸
B-309	环丙黄隆	喹氧乙酸
B-310	氟唑啉草	喹氧乙酸
B-311	氟定黄隆	喹氧乙酸
B-312	甲酰氨磺隆	喹氧乙酸
B-313	咪草啶酸	喹氧乙酸
B-314	甲基咪草烟	喹氧乙酸
B-315	灭草烟	喹氧乙酸
B-316	灭草喹	喹氧乙酸

[0569]

	除草剂B	安全剂C
B-317	咪草烟	喹氧乙酸
B-318	啶咪黄隆	喹氧乙酸
B-319	碘甲黄隆钠	喹氧乙酸
B-320	甲基二磺隆	喹氧乙酸
B-321	烟嘧黄隆	喹氧乙酸
B-322	五氟磺草胺	喹氧乙酸
B-323	丙苯磺隆	喹氧乙酸
B-324	吡嘧黄隆	喹氧乙酸
B-325	啶磺草胺	喹氧乙酸
B-326	五氟黄隆	喹氧乙酸
B-327	乙黄隆	喹氧乙酸
B-328	噻酮磺隆	喹氧乙酸
B-329	三氟甲磺隆	喹氧乙酸
B-330	2,4-D及其盐和酯	喹氧乙酸
B-331	氯草啶及其盐和酯	喹氧乙酸
B-332	二氯皮考啉酸及其盐和酯	喹氧乙酸
B-333	麦草畏及其盐和酯	喹氧乙酸
B-334	氟氯胺啶	喹氧乙酸
B-335	二氯喹啉酸	喹氧乙酸
B-336	喹草酸	喹氧乙酸
B-337	H-9	喹氧乙酸
B-338	二氟吡隆	喹氧乙酸
B-339	二氟吡隆	喹氧乙酸
B-340	异恶草酮	喹氧乙酸
B-341	吡氟草胺	喹氧乙酸
B-342	氟咯草酮	喹氧乙酸
B-343	异噁氟草	喹氧乙酸
B-344	甲基磺草酮	喹氧乙酸
B-345	氟吡酰草胺	喹氧乙酸
B-346	磺草酮	喹氧乙酸
B-347	特糠酯酮	喹氧乙酸
B-348	环磺酮	喹氧乙酸
B-349	苯吡唑草酮	喹氧乙酸
B-350	H-7	喹氧乙酸
B-351	莠去津	喹氧乙酸
B-352	敌草隆	喹氧乙酸

[0570]

	除草剂B	安全剂C
B-353	伏草隆	喹氧乙酸
B-354	六嗪同	喹氧乙酸
B-355	异丙隆	喹氧乙酸
B-356	赛克津	喹氧乙酸
B-357	敌稗	喹氧乙酸
B-358	特丁津	喹氧乙酸
B-359	对草快	喹氧乙酸
B-360	氟噁嗪酮	喹氧乙酸
B-361	乙氧氟草醚	喹氧乙酸
B-362	嘧啶𫂇草醚	喹氧乙酸
B-363	磺胺草唑	喹氧乙酸
B-364	H-1	喹氧乙酸
B-365	H-2	喹氧乙酸
B-366	草甘膦	喹氧乙酸
B-367	草甘膦异丙胺盐	喹氧乙酸
B-368	草硫膦	喹氧乙酸
B-369	草铵膦	喹氧乙酸
B-370	草铵膦	喹氧乙酸
B-371	胺硝草	喹氧乙酸
B-372	氟乐灵	喹氧乙酸
B-373	乙草胺	喹氧乙酸
B-374	唑草胺	喹氧乙酸
B-375	精噻吩草胺	喹氧乙酸
B-376	四唑酰草胺	喹氧乙酸
B-377	氟噻草胺	喹氧乙酸
B-378	苯噻草胺	喹氧乙酸
B-379	吡草胺	喹氧乙酸
B-380	S-异丙甲草胺	喹氧乙酸
B-381	派罗克杀草砒	喹氧乙酸
B-382	异恶草胺	喹氧乙酸
B-383	香草隆	喹氧乙酸
B-384	茚草酮	喹氧乙酸
B-385	氟噁嗪草	喹氧乙酸
B-386	苯氧丙胺津	喹氧乙酸
B-387	莠去津+ H-1	喹氧乙酸
B-388	莠去津+草甘膦	喹氧乙酸

[0571]

	除草剂B	安全剂C
B-389	莠去津+甲基磺草酮	喹氧乙酸
B-390	莠去津+烟嘧黄隆	喹氧乙酸
B-391	莠去津+环磺酮	喹氧乙酸
B-392	莠去津+苯吡唑草酮	喹氧乙酸
B-393	异恶草酮+草甘膦	喹氧乙酸
B-394	吡氟草胺+炔草酯	喹氧乙酸
B-395	吡氟草胺+高噁唑禾草灵	喹氧乙酸
B-396	吡氟草胺+氟定黄隆	喹氧乙酸
B-397	吡氟草胺+草甘膦	喹氧乙酸
B-398	吡氟草胺+甲基二磺隆	喹氧乙酸
B-399	吡氟草胺+唑啞草酯	喹氧乙酸
B-400	吡氟草胺+啶磺草胺	喹氧乙酸
B-401	氟唑啞草+草甘膦	喹氧乙酸
B-402	氟噁嗪酮+草甘膦	喹氧乙酸
B-403	甲基咪草烟+草甘膦	喹氧乙酸
B-404	咪草烟+草甘膦	喹氧乙酸
B-405	异噁氟草+H-1	喹氧乙酸
B-406	异噁氟草+草甘膦	喹氧乙酸
B-407	吡草胺+H-1	喹氧乙酸
B-408	吡草胺+草甘膦	喹氧乙酸
B-409	吡草胺+甲基磺草酮	喹氧乙酸
B-410	吡草胺+烟嘧黄隆	喹氧乙酸
B-411	吡草胺+特丁津	喹氧乙酸
B-412	吡草胺+苯吡唑草酮	喹氧乙酸
B-413	赛克津+草甘膦	喹氧乙酸
B-414	胺硝草+H-1	喹氧乙酸
B-415	胺硝草+炔草酯	喹氧乙酸
B-416	胺硝草+高噁唑禾草灵	喹氧乙酸
B-417	胺硝草+氟定黄隆	喹氧乙酸
B-418	胺硝草+草甘膦	喹氧乙酸
B-419	胺硝草+甲基二磺隆	喹氧乙酸
B-420	胺硝草+甲基磺草酮	喹氧乙酸
B-421	胺硝草+烟嘧黄隆	喹氧乙酸
B-422	胺硝草+唑啞草酯	喹氧乙酸
B-423	胺硝草+啶磺草胺	喹氧乙酸
B-424	胺硝草+环磺酮	喹氧乙酸

[0572]

	除草剂B	安全剂C
B-425	胺硝草+ 苯吡唑草酮	喹氧乙酸
B-426	派罗克杀草砒+ 环磺酮	喹氧乙酸
B-427	派罗克杀草砒+ 苯吡唑草酮	喹氧乙酸
B-428	磺胺草唑+草甘膦	喹氧乙酸
B-429	特丁津+ H-1	喹氧乙酸
B-430	特丁津+ 甲酰氯磺隆	喹氧乙酸
B-431	特丁津+ 草甘膦	喹氧乙酸
B-432	特丁津+ 甲基磺草酮	喹氧乙酸
B-433	特丁津+ 烟嘧黄隆	喹氧乙酸
B-434	特丁津+ 环磺酮	喹氧乙酸
B-435	特丁津+ 苯吡唑草酮	喹氧乙酸
B-436	氟乐灵+ 草甘膦	喹氧乙酸
B-437	炔草酯	抑害胺
B-438	噻草酮	抑害胺
B-439	氟氟草酯	抑害胺
B-440	高噁唑禾草灵	抑害胺
B-441	唑啉草酯	抑害胺
B-442	环苯草酮	抑害胺
B-443	酞肟草	抑害胺
B-444	肟草酮	抑害胺
B-445	禾草畏	抑害胺
B-446	苄草丹	抑害胺
B-447	杀草丹	抑害胺
B-448	野麦畏	抑害胺
B-449	苄嘧黄隆	抑害胺
B-450	双嘧苯甲酸钠	抑害胺
B-451	环丙黄隆	抑害胺
B-452	氟唑啉草	抑害胺
B-453	氟定黄隆	抑害胺
B-454	甲酰氯磺隆	抑害胺
B-455	咪草啶酸	抑害胺
B-456	甲基咪草烟	抑害胺
B-457	灭草烟	抑害胺
B-458	灭草喹	抑害胺
B-459	咪草烟	抑害胺
B-460	啶咪黄隆	抑害胺

[0573]

	除草剂B	安全剂C
B-461	碘甲黄隆钠	抑害胺
B-462	甲基二磺隆	抑害胺
B-463	烟嘧黄隆	抑害胺
B-464	五氟磺草胺	抑害胺
B-465	丙苯磺隆	抑害胺
B-466	吡嘧黄隆	抑害胺
B-467	啶磺草胺	抑害胺
B-468	玉嘧黄隆	抑害胺
B-469	乙黄黄隆	抑害胺
B-470	噻酮磺隆	抑害胺
B-471	三氟甲磺隆	抑害胺
B-472	2,4-D及其盐和酯	抑害胺
B-473	氯草啶及其盐和酯	抑害胺
B-474	二氯皮考啉酸及其盐和酯	抑害胺
B-475	麦草畏及其盐和酯	抑害胺
B-476	氟氯胺啶	抑害胺
B-477	二氯喹啉酸	抑害胺
B-478	喹草酸	抑害胺
B-479	H-9	抑害胺
B-480	二氟吡隆	抑害胺
B-481	二氟吡隆	抑害胺
B-482	异恶草酮	抑害胺
B-483	吡氟草胺	抑害胺
B-484	氟咯草酮	抑害胺
B-485	异噁氟草	抑害胺
B-486	甲基磺草酮	抑害胺
B-487	氟吡酰草胺	抑害胺
B-488	磺草酮	抑害胺
B-489	特糠酯酮	抑害胺
B-490	环磺酮	抑害胺
B-491	苯吡唑草酮	抑害胺
B-492	H-7	抑害胺
B-493	莠去津	抑害胺
B-494	敌草隆	抑害胺
B-495	伏草隆	抑害胺
B-496	六嗪同	抑害胺

[0574]

	除草剂B	安全剂C
B-497	异丙隆	抑害胺
B-498	赛克津	抑害胺
B-499	敌稗	抑害胺
B-500	特丁津	抑害胺
B-501	对草快	抑害胺
B-502	氟噁嗪酮	抑害胺
B-503	乙氧氟草醚	抑害胺
B-504	嘧啶𠄎草醚	抑害胺
B-505	磺胺草唑	抑害胺
B-506	H-1	抑害胺
B-507	H-2	抑害胺
B-508	草甘膦	抑害胺
B-509	草甘膦异丙胺盐	抑害胺
B-510	草硫膦	抑害胺
B-511	草铵膦	抑害胺
B-512	草铵膦	抑害胺
B-513	胺硝草	抑害胺
B-514	氟乐灵	抑害胺
B-515	乙草胺	抑害胺
B-516	唑草胺	抑害胺
B-517	精噁吩草胺	抑害胺
B-518	四唑酰草胺	抑害胺
B-519	氟噁草胺	抑害胺
B-520	苯噁草胺	抑害胺
B-521	吡草胺	抑害胺
B-522	S-异丙甲草胺	抑害胺
B-523	派罗克杀草砒	抑害胺
B-524	异恶草胺	抑害胺
B-525	香草隆	抑害胺
B-526	茚草酮	抑害胺
B-527	氟噁嗪草	抑害胺
B-528	苯氧丙胺津	抑害胺
B-529	莠去津+ H-1	抑害胺
B-530	莠去津+草甘膦	抑害胺
B-531	莠去津+甲基磺草酮	抑害胺
B-532	莠去津+烟嘧黄隆	抑害胺

[0575]

	除草剂B	安全剂C
B-533	莠去津+ 环磺酮	抑害胺
B-534	莠去津+ 苯吡唑草酮	抑害胺
B-535	异恶草酮+草甘膦	抑害胺
B-536	吡氟草胺+炔草酯	抑害胺
B-537	吡氟草胺+高噁唑禾草灵	抑害胺
B-538	吡氟草胺+氟定黄隆	抑害胺
B-539	吡氟草胺+草甘膦	抑害胺
B-540	吡氟草胺+甲基二磺隆	抑害胺
B-541	吡氟草胺+唑啞草酯	抑害胺
B-542	吡氟草胺+啶磺草胺	抑害胺
B-543	氟唑啞草+草甘膦	抑害胺
B-544	氟噁嗪酮+草甘膦	抑害胺
B-545	甲基咪草烟+草甘膦	抑害胺
B-546	咪草烟+草甘膦	抑害胺
B-547	异噁氟草+ H-1	抑害胺
B-548	异噁氟草+草甘膦	抑害胺
B-549	吡草胺+ H-1	抑害胺
B-550	吡草胺+草甘膦	抑害胺
B-551	吡草胺+甲基磺草酮	抑害胺
B-552	吡草胺+烟嘧黄隆	抑害胺
B-553	吡草胺+特丁津	抑害胺
B-554	吡草胺+ 苯吡唑草酮	抑害胺
B-555	赛克津+草甘膦	抑害胺
B-556	胺硝草+ H-1	抑害胺
B-557	胺硝草+炔草酯	抑害胺
B-558	胺硝草+高噁唑禾草灵	抑害胺
B-559	胺硝草+氟定黄隆	抑害胺
B-560	胺硝草+草甘膦	抑害胺
B-561	胺硝草+甲基二磺隆	抑害胺
B-562	胺硝草+甲基磺草酮	抑害胺
B-563	胺硝草+烟嘧黄隆	抑害胺
B-564	胺硝草+唑啞草酯	抑害胺
B-565	胺硝草+啶磺草胺	抑害胺
B-566	胺硝草+ 环磺酮	抑害胺
B-567	胺硝草+ 苯吡唑草酮	抑害胺
B-568	派罗克杀草砒+ 环磺酮	抑害胺

[0576]

	除草剂B	安全剂C
B-569	派罗克杀草砒+苯吡唑草酮	抑害胺
B-570	磺胺草唑+草甘膦	抑害胺
B-571	特丁津(ferbuthylazin) + H-1	抑害胺
B-572	特丁津+甲酰氨基磺隆	抑害胺
B-573	特丁津+草甘膦	抑害胺
B-574	特丁津+甲基磺草酮	抑害胺
B-575	特丁津+烟嘧黄隆	抑害胺
B-576	特丁津+环磺酮	抑害胺
B-577	特丁津+苯吡唑草酮	抑害胺
B-578	氟乐灵+草甘膦	抑害胺
B-579	炔草酯	解草唑
B-580	噻草酮	解草唑
B-581	氟氟草酯	解草唑
B-582	高噁唑禾草灵	解草唑
B-583	唑啉草酯	解草唑
B-584	环苯草酮	解草唑
B-585	酞肟草	解草唑
B-586	肟草酮	解草唑
B-587	禾草畏	解草唑
B-588	苄草丹	解草唑
B-589	杀草丹	解草唑
B-590	野麦畏	解草唑
B-591	苄嘧黄隆	解草唑
B-592	双嘧苯甲酸钠	解草唑
B-593	环丙黄隆	解草唑
B-594	氟唑啉草	解草唑
B-595	氟定黄隆	解草唑
B-596	甲酰氨基磺隆	解草唑
B-597	咪草啶酸	解草唑
B-598	甲基咪草烟	解草唑
B-599	灭草烟	解草唑
B-600	灭草嗪	解草唑
B-601	咪草烟	解草唑
B-602	啶咪黄隆	解草唑
B-603	碘甲黄隆钠	解草唑
B-604	甲基二磺隆	解草唑

[0577]

	除草剂B	安全剂C
B-605	烟嘧黄隆	解草唑
B-606	五氟磺草胺	解草唑
B-607	丙苯磺隆	解草唑
B-608	吡嘧黄隆	解草唑
B-609	啶磺草胺	解草唑
B-610	玉嘧黄隆	解草唑
B-611	乙黄隆	解草唑
B-612	噻酮磺隆	解草唑
B-613	三氟甲磺隆	解草唑
B-614	2,4-D及其盐和酯	解草唑
B-615	氟草啶及其盐和酯	解草唑
B-616	二氟皮考啉酸及其盐和酯	解草唑
B-617	麦草畏及其盐和酯	解草唑
B-618	氟氯胺啶	解草唑
B-619	二氟喹啉酸	解草唑
B-620	喹草酸	解草唑
B-621	H-9	解草唑
B-622	二氟吡隆	解草唑
B-623	二氟吡隆	解草唑
B-624	异恶草酮	解草唑
B-625	吡氟草胺	解草唑
B-626	氟咯草酮	解草唑
B-627	异恶氟草	解草唑
B-628	甲基磺草酮	解草唑
B-629	氟吡酰草胺	解草唑
B-630	磺草酮	解草唑
B-631	特糠酯酮	解草唑
B-632	环磺酮	解草唑
B-633	苯吡唑草酮	解草唑
B-634	H-7	解草唑
B-635	莠去津	解草唑
B-636	敌草隆	解草唑
B-637	伏草隆	解草唑
B-638	六嗪同	解草唑
B-639	异丙隆	解草唑
B-640	赛克津	解草唑

[0578]

	除草剂B	安全剂C
B-641	敌稗	解草唑
B-642	特丁津	解草唑
B-643	对草快	解草唑
B-644	氟噁嗪酮	解草唑
B-645	乙氧氟草醚	解草唑
B-646	嘧啶𠝹草醚	解草唑
B-647	磺胺草唑	解草唑
B-648	H-1	解草唑
B-649	H-2	解草唑
B-650	草甘膦	解草唑
B-651	草甘膦异丙胺盐	解草唑
B-652	草硫膦	解草唑
B-653	草铵膦	解草唑
B-654	草铵膦	解草唑
B-655	胺硝草	解草唑
B-656	氟乐灵	解草唑
B-657	乙草胺	解草唑
B-658	唑草胺	解草唑
B-659	精噻吩草胺	解草唑
B-660	四唑酰草胺	解草唑
B-661	氟噻草胺	解草唑
B-662	苯噻草胺	解草唑
B-663	吡草胺	解草唑
B-664	S-异丙甲草胺	解草唑
B-665	派罗克杀草砒	解草唑
B-666	异恶草胺	解草唑
B-667	香草隆	解草唑
B-668	茚草酮	解草唑
B-669	氟噁嗪草	解草唑
B-670	苯氧丙胺津(friaziflam)	解草唑
B-671	莠去津+ H-1	解草唑
B-672	莠去津+草甘膦	解草唑
B-673	莠去津+甲基磺草酮	解草唑
B-674	莠去津+烟嘧黄隆	解草唑
B-675	莠去津+ 环磺酮	解草唑
B-676	莠去津+ 苯吡唑草酮	解草唑

[0579]

	除草剂B	安全剂C
B-677	异恶草酮+草甘膦	解草唑
B-678	吡氟草胺+炔草酯	解草唑
B-679	吡氟草胺+高噁唑禾草灵	解草唑
B-680	吡氟草胺+氟定黄隆	解草唑
B-681	吡氟草胺+草甘膦	解草唑
B-682	吡氟草胺+甲基二磺隆	解草唑
B-683	吡氟草胺+唑啞草酯	解草唑
B-684	吡氟草胺+啶磺草胺	解草唑
B-685	氟唑啞草+草甘膦	解草唑
B-686	氟噁嗪酮+草甘膦	解草唑
B-687	甲基咪草烟+草甘膦	解草唑
B-688	咪草烟+草甘膦	解草唑
B-689	异噁氟草+ H-1	解草唑
B-690	异噁氟草+草甘膦	解草唑
B-691	吡草胺+ H-1	解草唑
B-692	吡草胺+草甘膦	解草唑
B-693	吡草胺+甲基磺草酮	解草唑
B-694	吡草胺+烟嘧黄隆	解草唑
B-695	吡草胺+特丁津	解草唑
B-696	吡草胺+苯吡唑草酮	解草唑
B-697	赛克津+草甘膦	解草唑
B-698	胺硝草+ H-1	解草唑
B-699	胺硝草+炔草酯	解草唑
B-700	胺硝草+高噁唑禾草灵	解草唑
B-701	胺硝草+氟定黄隆	解草唑
B-702	胺硝草+草甘膦	解草唑
B-703	胺硝草+甲基二磺隆	解草唑
B-704	胺硝草+甲基磺草酮	解草唑
B-705	胺硝草+烟嘧黄隆	解草唑
B-706	胺硝草+唑啞草酯	解草唑
B-707	胺硝草+啶磺草胺	解草唑
B-708	胺硝草+环磺酮	解草唑
B-709	胺硝草+苯吡唑草酮	解草唑
B-710	派罗克杀草砒+环磺酮	解草唑
B-711	派罗克杀草砒+苯吡唑草酮	解草唑
B-712	磺胺草唑+草甘膦	解草唑

[0580]

	除草剂B	安全剂C
B-713	特丁津+ H-1	解草唑
B-714	特丁津+ 甲酰氯磺隆	解草唑
B-715	特丁津+ 草甘膦	解草唑
B-716	特丁津+ 甲基磺草酮	解草唑
B-717	特丁津+ 烟嘧黄隆	解草唑
B-718	特丁津+ 环磺酮	解草唑
B-719	特丁津+ 苯吡唑草酮	解草唑
B-720	氟乐灵+ 草甘膦	解草唑
B-721	炔草酯	双苯噁唑酸
B-722	噻草酮	双苯噁唑酸
B-723	氟氟草酯	双苯噁唑酸
B-724	高噁唑禾草灵	双苯噁唑酸
B-725	唑啞草酯	双苯噁唑酸
B-726	环苯草酮	双苯噁唑酸
B-727	酞肟草	双苯噁唑酸
B-728	肟草酮	双苯噁唑酸
B-729	禾草畏	双苯噁唑酸
B-730	苄草丹	双苯噁唑酸
B-731	杀草丹	双苯噁唑酸
B-732	野麦畏	双苯噁唑酸
B-733	苄嘧黄隆	双苯噁唑酸
B-734	双嘧苯甲酸钠	双苯噁唑酸
B-735	环丙黄隆	双苯噁唑酸
B-736	氟唑啞草	双苯噁唑酸
B-737	氟定黄隆	双苯噁唑酸
B-738	甲酰氯磺隆	双苯噁唑酸
B-739	咪草啞酸	双苯噁唑酸
B-740	甲基咪草烟	双苯噁唑酸
B-741	灭草烟	双苯噁唑酸
B-742	灭草嗪	双苯噁唑酸
B-743	咪草烟	双苯噁唑酸
B-744	啞咪黄隆	双苯噁唑酸
B-745	碘甲黄隆钠	双苯噁唑酸
B-746	甲基二磺隆	双苯噁唑酸
B-747	烟嘧黄隆	双苯噁唑酸
B-748	五氟磺草胺	双苯噁唑酸

[0581]

	除草剂B	安全剂C
B-749	丙苯磺隆	双苯噁唑酸
B-750	吡嘧黄隆	双苯噁唑酸
B-751	啶磺草胺	双苯噁唑酸
B-752	玉嘧黄隆	双苯噁唑酸
B-753	乙黄隆	双苯噁唑酸
B-754	噻酮磺隆	双苯噁唑酸
B-755	三氟甲磺隆	双苯噁唑酸
B-756	2,4-D及其盐和酯	双苯噁唑酸
B-757	氯草啶及其盐和酯	双苯噁唑酸
B-758	二氯皮考啉酸及其盐和酯	双苯噁唑酸
B-759	麦草畏及其盐和酯	双苯噁唑酸
B-760	氟氯胺啶	双苯噁唑酸
B-761	二氯喹啉酸	双苯噁唑酸
B-762	喹草酸	双苯噁唑酸
B-763	H-9	双苯噁唑酸
B-764	二氟吡隆	双苯噁唑酸
B-765	二氟吡隆	双苯噁唑酸
B-766	异恶草酮	双苯噁唑酸
B-767	吡氟草胺	双苯噁唑酸
B-768	氟咯草酮	双苯噁唑酸
B-769	异噁氟草	双苯噁唑酸
B-770	甲基磺草酮	双苯噁唑酸
B-771	氟吡酰草胺	双苯噁唑酸
B-772	磺草酮	双苯噁唑酸
B-773	特糠酯酮	双苯噁唑酸
B-774	环磺酮	双苯噁唑酸
B-775	苯吡唑草酮	双苯噁唑酸
B-776	H-7	双苯噁唑酸
B-777	莠去津	双苯噁唑酸
B-778	敌草隆	双苯噁唑酸
B-779	伏草隆	双苯噁唑酸
B-780	六嗪同	双苯噁唑酸
B-781	异丙隆	双苯噁唑酸
B-782	赛克津	双苯噁唑酸
B-783	敌稗	双苯噁唑酸
B-784	特丁津	双苯噁唑酸

[0582]

	除草剂B	安全剂C
B-785	对草快	双苯噁唑酸
B-786	氟噁嗪酮	双苯噁唑酸
B-787	乙氧氟草醚	双苯噁唑酸
B-788	嘧啶肟草醚	双苯噁唑酸
B-789	磺胺草唑	双苯噁唑酸
B-790	H-1	双苯噁唑酸
B-791	H-2	双苯噁唑酸
B-792	草甘膦	双苯噁唑酸
B-793	草甘膦异丙胺盐	双苯噁唑酸
B-794	草硫膦	双苯噁唑酸
B-795	草铵膦	双苯噁唑酸
B-796	草铵膦	双苯噁唑酸
B-797	胺硝草	双苯噁唑酸
B-798	氟乐灵	双苯噁唑酸
B-799	乙草胺	双苯噁唑酸
B-800	唑草胺	双苯噁唑酸
B-801	精噻吩草胺	双苯噁唑酸
B-802	四唑酰草胺	双苯噁唑酸
B-803	氟噻草胺	双苯噁唑酸
B-804	苯噻草胺	双苯噁唑酸
B-805	吡草胺	双苯噁唑酸
B-806	S-异丙甲草胺	双苯噁唑酸
B-807	派罗克杀草砒	双苯噁唑酸
B-808	异恶草胺	双苯噁唑酸
B-809	香草隆	双苯噁唑酸
B-810	茚草酮	双苯噁唑酸
B-811	氟噁嗪草	双苯噁唑酸
B-812	苯氧丙胺津	双苯噁唑酸
B-813	莠去津+ H-1	双苯噁唑酸
B-814	莠去津+草甘膦	双苯噁唑酸
B-815	莠去津+甲基磺草酮	双苯噁唑酸
B-816	莠去津+烟嘧黄隆	双苯噁唑酸
B-817	莠去津+ 环磺酮	双苯噁唑酸
B-818	莠去津+ 苯吡唑草酮	双苯噁唑酸
B-819	异恶草酮+草甘膦	双苯噁唑酸
B-820	吡氟草胺+炔草酯	双苯噁唑酸

[0583]

	除草剂B	安全剂C
B-821	吡氟草胺+高噁唑禾草灵	双苯噁唑酸
B-822	吡氟草胺+氟定黄隆	双苯噁唑酸
B-823	吡氟草胺+草甘膦	双苯噁唑酸
B-824	吡氟草胺+甲基二磺隆	双苯噁唑酸
B-825	吡氟草胺+唑啞草酯	双苯噁唑酸
B-826	吡氟草胺+啶磺草胺	双苯噁唑酸
B-827	氟唑啞草+草甘膦	双苯噁唑酸
B-828	氟噁嗪酮+草甘膦	双苯噁唑酸
B-829	甲基咪草烟+草甘膦	双苯噁唑酸
B-830	咪草烟+草甘膦	双苯噁唑酸
B-831	异噁氟草+ H-1	双苯噁唑酸
B-832	异噁氟草+草甘膦	双苯噁唑酸
B-833	吡草胺+ H-1	双苯噁唑酸
B-834	吡草胺+草甘膦	双苯噁唑酸
B-835	吡草胺+甲基磺草酮	双苯噁唑酸
B-836	吡草胺+烟嘧黄隆	双苯噁唑酸
B-837	吡草胺+特丁津	双苯噁唑酸
B-838	吡草胺+ 苯吡唑草酮	双苯噁唑酸
B-839	赛克津+草甘膦	双苯噁唑酸
B-840	胺硝草+ H-1	双苯噁唑酸
B-841	胺硝草+炔草酯	双苯噁唑酸
B-842	胺硝草+高噁唑禾草灵	双苯噁唑酸
B-843	胺硝草+氟定黄隆	双苯噁唑酸
B-844	胺硝草+草甘膦	双苯噁唑酸
B-845	胺硝草+甲基二磺隆	双苯噁唑酸
B-846	胺硝草+甲基磺草酮	双苯噁唑酸
B-847	胺硝草+烟嘧黄隆	双苯噁唑酸
B-848	胺硝草+唑啞草酯	双苯噁唑酸
B-849	胺硝草+啶磺草胺	双苯噁唑酸
B-850	胺硝草+ 环磺酮	双苯噁唑酸
B-851	胺硝草+ 苯吡唑草酮	双苯噁唑酸
B-852	派罗克杀草砒+ 环磺酮	双苯噁唑酸
B-853	派罗克杀草砒+ 苯吡唑草酮	双苯噁唑酸
B-854	磺胺草唑+草甘膦	双苯噁唑酸
B-855	特丁津+ H-1	双苯噁唑酸
B-856	特丁津+ 甲酰氨磺隆	双苯噁唑酸

[0584]

	除草剂B	安全剂C
B-857	特丁津+草甘膦	双苯噁唑酸
B-858	特丁津+甲基磺草酮	双苯噁唑酸
B-859	特丁津+烟嘧黄隆	双苯噁唑酸
B-860	特丁津+环磺酮	双苯噁唑酸
B-861	特丁津+苯吡唑草酮	双苯噁唑酸
B-862	氟乐灵+草甘膦	双苯噁唑酸
B-863	炔草酯	吡咯二酸
B-864	噻草酮	吡咯二酸
B-865	氟氟草酯	吡咯二酸
B-866	高噁唑禾草灵	吡咯二酸
B-867	唑啉草酯	吡咯二酸
B-868	环苯草酮	吡咯二酸
B-869	酞肟草	吡咯二酸
B-870	肟草酮	吡咯二酸
B-871	禾草畏	吡咯二酸
B-872	苄草丹	吡咯二酸
B-873	杀草丹	吡咯二酸
B-874	野麦畏	吡咯二酸
B-875	苄嘧黄隆	吡咯二酸
B-876	双嘧苯甲酸钠	吡咯二酸
B-877	环丙黄隆	吡咯二酸
B-878	氟唑啉草	吡咯二酸
B-879	氟定黄隆	吡咯二酸
B-880	甲酰氟磺隆	吡咯二酸
B-881	咪草啶酸	吡咯二酸
B-882	甲基咪草烟	吡咯二酸
B-883	灭草烟	吡咯二酸
B-884	灭草嗪	吡咯二酸
B-885	咪草烟	吡咯二酸
B-886	啶咪黄隆	吡咯二酸
B-887	碘甲黄隆钠	吡咯二酸
B-888	甲基二磺隆	吡咯二酸
B-889	烟嘧黄隆	吡咯二酸
B-890	五氟磺草胺	吡咯二酸
B-891	丙苯磺隆	吡咯二酸
B-892	吡嘧黄隆	吡咯二酸

[0585]

	除草剂B	安全剂C
B-893	啶磺草胺	吡咯二酸
B-894	玉嘧黄隆	吡咯二酸
B-895	乙黄黄隆	吡咯二酸
B-896	噻酮磺隆	吡咯二酸
B-897	三氟甲磺隆	吡咯二酸
B-898	2,4-D及其盐和酯	吡咯二酸
B-899	氨草啶及其盐和酯	吡咯二酸
B-900	二氯皮考啉酸及其盐和酯	吡咯二酸
B-901	麦草畏及其盐和酯	吡咯二酸
B-902	氟氯胺啶	吡咯二酸
B-903	二氯喹啉酸	吡咯二酸
B-904	喹草酸	吡咯二酸
B-905	H-9	吡咯二酸
B-906	二氟吡隆	吡咯二酸
B-907	二氟吡隆	吡咯二酸
B-908	异恶草酮	吡咯二酸
B-909	吡氟草胺	吡咯二酸
B-910	氟咯草酮	吡咯二酸
B-911	异噁氟草	吡咯二酸
B-912	甲基磺草酮	吡咯二酸
B-913	氟吡酰草胺	吡咯二酸
B-914	磺草酮	吡咯二酸
B-915	特糠酯酮	吡咯二酸
B-916	环磺酮	吡咯二酸
B-917	苯吡唑草酮	吡咯二酸
B-918	H-7	吡咯二酸
B-919	莠去津	吡咯二酸
B-920	敌草隆	吡咯二酸
B-921	伏草隆	吡咯二酸
B-922	六嗪同	吡咯二酸
B-923	异丙隆	吡咯二酸
B-924	赛克津	吡咯二酸
B-925	敌稗	吡咯二酸
B-926	特丁津	吡咯二酸
B-927	对草快	吡咯二酸
B-928	氟噁嗪酮	吡咯二酸

[0586]

	除草剂B	安全剂C
B-929	乙氧氟草醚	吡咯二酸
B-930	嘧啶肟草醚	吡咯二酸
B-931	磺胺草唑	吡咯二酸
B-932	H-1	吡咯二酸
B-933	H-2	吡咯二酸
B-934	草甘膦	吡咯二酸
B-935	草甘膦异丙胺盐	吡咯二酸
B-936	草硫膦	吡咯二酸
B-937	草铵膦	吡咯二酸
B-938	草铵膦	吡咯二酸
B-939	胺硝草	吡咯二酸
B-940	氟乐灵	吡咯二酸
B-941	乙草胺	吡咯二酸
B-942	唑草胺	吡咯二酸
B-943	精噻吩草胺	吡咯二酸
B-944	四唑酰草胺	吡咯二酸
B-945	氟噻草胺	吡咯二酸
B-946	苯噻草胺	吡咯二酸
B-947	吡草胺	吡咯二酸
B-948	S-异丙甲草胺	吡咯二酸
B-949	派罗克杀草砒	吡咯二酸
B-950	异恶草胺	吡咯二酸
B-951	香草隆	吡咯二酸
B-952	茚草酮	吡咯二酸
B-953	氯噁嗪草	吡咯二酸
B-954	苯氧丙胺津	吡咯二酸
B-955	莠去津+ H-1	吡咯二酸
B-956	莠去津+草甘膦	吡咯二酸
B-957	莠去津+甲基磺草酮	吡咯二酸
B-958	莠去津+烟嘧黄隆	吡咯二酸
B-959	莠去津+ 环磺酮	吡咯二酸
B-960	莠去津+ 苯吡唑草酮	吡咯二酸
B-961	异恶草酮+草甘膦	吡咯二酸
B-962	吡氟草胺+炔草酯	吡咯二酸
B-963	吡氟草胺+高噁唑禾草灵	吡咯二酸
B-964	吡氟草胺+氟定黄隆	吡咯二酸

[0587]

	除草剂B	安全剂C
B-965	吡氟草胺+草甘膦	吡咯二酸
B-966	吡氟草胺+甲基二磺隆	吡咯二酸
B-967	吡氟草胺+唑啞草酯	吡咯二酸
B-968	吡氟草胺+啶磺草胺	吡咯二酸
B-969	氟唑啞草+草甘膦	吡咯二酸
B-970	氟噁嗪酮+草甘膦	吡咯二酸
B-971	甲基咪草烟+草甘膦	吡咯二酸
B-972	咪草烟+草甘膦	吡咯二酸
B-973	异噁氟草+ H-1	吡咯二酸
B-974	异噁氟草+草甘膦	吡咯二酸
B-975	吡草胺+ H-1	吡咯二酸
B-976	吡草胺+草甘膦	吡咯二酸
B-977	吡草胺+甲基磺草酮	吡咯二酸
B-978	吡草胺+烟嘧黄隆	吡咯二酸
B-979	吡草胺+特丁津	吡咯二酸
B-980	吡草胺+苯吡唑草酮	吡咯二酸
B-981	赛克津+草甘膦	吡咯二酸
B-982	胺硝草+ H-1	吡咯二酸
B-983	胺硝草+炔草酯	吡咯二酸
B-984	胺硝草+高噁唑禾草灵	吡咯二酸
B-985	胺硝草+氟定黄隆	吡咯二酸
B-986	胺硝草+草甘膦	吡咯二酸
B-987	胺硝草+甲基二磺隆	吡咯二酸
B-988	胺硝草+甲基磺草酮	吡咯二酸
B-989	胺硝草+烟嘧黄隆	吡咯二酸
B-990	胺硝草+唑啞草酯	吡咯二酸
B-991	胺硝草+啶磺草胺	吡咯二酸
B-992	胺硝草+环磺酮	吡咯二酸
B-993	胺硝草+苯吡唑草酮	吡咯二酸
B-994	派罗克杀草砒+环磺酮	吡咯二酸
B-995	派罗克杀草砒+苯吡唑草酮	吡咯二酸
B-996	磺胺草唑+草甘膦	吡咯二酸
B-997	特丁津+ H-1	吡咯二酸
B-998	特丁津+甲酰氨磺隆	吡咯二酸
B-999	特丁津+草甘膦	吡咯二酸
B-1000	特丁津+甲基磺草酮	吡咯二酸

[0588]

	除草剂B	安全剂C
B-1001	特丁津+烟嘧黄隆	吡咯二酸
B-1002	特丁津+环磺酮	吡咯二酸
B-1003	特丁津+苯吡唑草酮	吡咯二酸
B-1004	氟乐灵+草甘膦	吡咯二酸
B-1005	炔草酯	H-12
B-1006	噻草酮	H-12
B-1007	氟氟草酯	H-12
B-1008	高噁唑禾草灵	H-12
B-1009	唑啉草酯	H-12
B-1010	环苯草酮	H-12
B-1011	酞肟草	H-12
B-1012	肟草酮	H-12
B-1013	禾草畏	H-12
B-1014	苄草丹	H-12
B-1015	杀草丹	H-12
B-1016	野麦畏	H-12
B-1017	苄嘧黄隆	H-12
B-1018	双嘧苯甲酸钠	H-12
B-1019	环丙黄隆	H-12
B-1020	氟唑啉草	H-12
B-1021	氟定黄隆	H-12
B-1022	甲酰氟磺隆	H-12
B-1023	咪草啶酸	H-12
B-1024	甲基咪草烟	H-12
B-1025	灭草烟	H-12
B-1026	灭草喹	H-12
B-1027	咪草烟	H-12
B-1028	啶咪黄隆	H-12
B-1029	碘甲黄隆钠	H-12
B-1030	甲基二磺隆	H-12
B-1031	烟嘧黄隆	H-12
B-1032	五氟磺草胺	H-12
B-1033	丙苯磺隆	H-12
B-1034	吡嘧黄隆	H-12
B-1035	啶磺草胺	H-12
B-1036	玉嘧黄隆	H-12

[0589]

	除草剂B	安全剂C
B-1037	乙黄隆	H-12
B-1038	噻酮磺隆	H-12
B-1039	三氟甲磺隆	H-12
B-1040	2,4-D及其盐和酯	H-12
B-1041	氯草啶及其盐和酯	H-12
B-1042	二氯皮考啉酸及其盐和酯	H-12
B-1043	麦草畏及其盐和酯	H-12
B-1044	氟氯胺啶	H-12
B-1045	二氯喹啉酸	H-12
B-1046	喹草酸	H-12
B-1047	H-9	H-12
B-1048	二氯吡隆	H-12
B-1049	二氯吡隆	H-12
B-1050	异恶草酮	H-12
B-1051	吡氟草胺	H-12
B-1052	氟咯草酮	H-12
B-1053	异恶氟草	H-12
B-1054	甲基磺草酮	H-12
B-1055	氟吡酰草胺	H-12
B-1056	磺草酮	H-12
B-1057	特糠酯酮	H-12
B-1058	环磺酮	H-12
B-1059	苯吡唑草酮	H-12
B-1060	H-7	H-12
B-1061	莠去津	H-12
B-1062	敌草隆	H-12
B-1063	伏草隆	H-12
B-1064	六嗪同	H-12
B-1065	异丙隆	H-12
B-1066	赛克津	H-12
B-1067	敌稗	H-12
B-1068	特丁津	H-12
B-1069	对草快	H-12
B-1070	氟恶嗪酮	H-12
B-1071	乙氧氟草醚	H-12
B-1072	噻啶肟草醚	H-12

[0590]

	除草剂B	安全剂C
B-1073	磺胺草唑	H-12
B-1074	H-1	H-12
B-1075	H-2	H-12
B-1076	草甘膦	H-12
B-1077	草甘膦异丙胺盐	H-12
B-1078	草硫膦	H-12
B-1079	草铵膦	H-12
B-1080	草铵膦	H-12
B-1081	胺硝草	H-12
B-1082	氟乐灵	H-12
B-1083	乙草胺	H-12
B-1084	唑草胺	H-12
B-1085	精噻吩草胺	H-12
B-1086	四唑酰草胺	H-12
B-1087	氟噻草胺	H-12
B-1088	苯噻草胺	H-12
B-1089	吡草胺	H-12
B-1090	S-异丙甲草胺	H-12
B-1091	派罗克杀草砒	H-12
B-1092	异恶草胺	H-12
B-1093	香草隆	H-12
B-1094	茚草酮	H-12
B-1095	氯噁嗪草	H-12
B-1096	苯氧丙胺津	H-12
B-1097	莠去津+ H-1	H-12
B-1098	莠去津+草甘膦	H-12
B-1099	莠去津+甲基磺草酮	H-12
B-1100	莠去津+烟嘧黄隆	H-12
B-1101	莠去津+ 环磺酮	H-12
B-1102	莠去津+ 苯吡唑草酮	H-12
B-1103	异恶草酮+草甘膦	H-12
B-1104	吡氟草胺+炔草酯	H-12
B-1105	吡氟草胺+高噁唑禾草灵	H-12
B-1106	吡氟草胺+氟定黄隆	H-12
B-1107	吡氟草胺+草甘膦	H-12
B-1108	吡氟草胺+甲基二磺隆	H-12

[0591]

	除草剂B	安全剂C
B-1109	吡氟草胺+唑啞草酯	H-12
B-1110	吡氟草胺+啶磺草胺	H-12
B-1111	氟唑啞草+草甘膦	H-12
B-1112	氟噁嗪酮+草甘膦	H-12
B-1113	甲基咪草烟+草甘膦	H-12
B-1114	咪草烟+草甘膦	H-12
B-1115	异噁氟草+ H-1	H-12
B-1116	异噁氟草+草甘膦	H-12
B-1117	吡草胺+ H-1	H-12
B-1118	吡草胺+草甘膦	H-12
B-1119	吡草胺+甲基磺草酮	H-12
B-1120	吡草胺+烟嘧黄隆	H-12
B-1121	吡草胺+特丁津	H-12
B-1122	吡草胺+苯吡唑草酮	H-12
B-1123	赛克津+草甘膦	H-12
B-1124	胺硝草+ H-1	H-12
B-1125	胺硝草+炔草酯	H-12
B-1126	胺硝草+高噁唑禾草灵	H-12
B-1127	胺硝草+氟定黄隆	H-12
B-1128	胺硝草+草甘膦	H-12
B-1129	胺硝草+甲基二磺隆	H-12
B-1130	胺硝草+甲基磺草酮	H-12
B-1131	胺硝草+烟嘧黄隆	H-12
B-1132	胺硝草+唑啞草酯	H-12
B-1133	胺硝草+啶磺草胺	H-12
B-1134	胺硝草+环磺酮	H-12
B-1135	胺硝草+苯吡唑草酮	H-12
B-1136	派罗克杀草砒+环磺酮	H-12
B-1137	派罗克杀草砒+苯吡唑草酮	H-12
B-1138	磺胺草唑+草甘膦	H-12
B-1139	特丁津+ H-1	H-12
B-1140	特丁津+甲酰氨磺隆	H-12
B-1141	特丁津+草甘膦	H-12
B-1142	特丁津+甲基磺草酮	H-12
B-1143	特丁津+烟嘧黄隆	H-12
B-1144	特丁津+环磺酮	H-12

[0592]

	除草剂B	安全剂C
B-1145	特丁津+ 苯吡唑草酮	H-12
B-1146	氟乐灵+草甘膦	H-12
B-1147	2-1	--
B-1148	2-2	--
B-1149	2-3	--
B-1150	2-4	--
B-1151	2-5	--
B-1152	2-6	--
B-1153	2-7	--
B-1154	2-8	--
B-1155	2-9	--
B-1156	2-1	解草酮
B-1157	2-2	解草酮
B-1158	2-3	解草酮
B-1159	2-4	解草酮
B-1160	2-5	解草酮
B-1161	2-6	解草酮
B-1162	2-7	解草酮
B-1163	2-8	解草酮
B-1164	2-9	解草酮
B-1165	2-1	喹氧乙酸
B-1166	2-2	喹氧乙酸
B-1167	2-3	喹氧乙酸
B-1168	2-4	喹氧乙酸
B-1169	2-5	喹氧乙酸
B-1170	2-6	喹氧乙酸
B-1171	2-7	喹氧乙酸
B-1172	2-8	喹氧乙酸
B-1173	2-9	喹氧乙酸
B-1174	2-1	环丙磺酰胺
B-1175	2-2	环丙磺酰胺
B-1176	2-3	环丙磺酰胺
B-1177	2-4	环丙磺酰胺
B-1178	2-5	环丙磺酰胺
B-1179	2-6	环丙磺酰胺
B-1180	2-7	环丙磺酰胺
B-1181	2-8	环丙磺酰胺

[0593]

	除草剂B	安全剂C
B-1182	2-9	环丙磺酰胺
B-1183	2-1	抑害胺
B-1184	2-2	抑害胺
B-1185	2-3	抑害胺
B-1186	2-4	抑害胺
B-1187	2-5	抑害胺
B-1188	2-6	抑害胺
B-1189	2-7	抑害胺
B-1190	2-8	抑害胺
B-1191	2-9	抑害胺
B-1192	2-1	解草唑
B-1193	2-2	解草唑
B-1194	2-3	解草唑
B-1195	2-4	解草唑
B-1196	2-5	解草唑
B-1197	2-6	解草唑
B-1198	2-7	解草唑
B-1199	2-8	解草唑
B-1200	2-9	解草唑
B-1201	2-1	双苯噁唑酸
B-1202	2-2	双苯噁唑酸
B-1203	2-3	双苯噁唑酸
B-1204	2-4	双苯噁唑酸
B-1205	2-5	双苯噁唑酸
B-1206	2-6	双苯噁唑酸
B-1207	2-7	双苯噁唑酸
B-1208	2-8	双苯噁唑酸
B-1209	2-9	双苯噁唑酸
B-1210	2-1	吡咯二酸
B-1211	2-2	吡咯二酸
B-1212	2-3	吡咯二酸
B-1213	2-4	吡咯二酸
B-1214	2-5	吡咯二酸
B-1215	2-6	吡咯二酸
B-1216	2-7	吡咯二酸
B-1217	2-8	吡咯二酸

[0594]

	除草剂B	安全剂C
B-1218	2-9	吡咯二酸
B-1219	2-1	H-11
B-1220	2-2	H-11
B-1221	2-3	H-11
B-1222	2-4	H-11
B-1223	2-5	H-11
B-1224	2-6	H-11
B-1225	2-7	H-11
B-1226	2-8	H-11
B-1227	2-9	H-11
B-1228	2-1	H-12
B-1229	2-2	H-12
B-1230	2-3	H-12
B-1231	2-4	H-12
B-1232	2-5	H-12
B-1233	2-6	H-12
B-1234	2-7	H-12
B-1235	2-8	H-12
B-1236	2-9	H-12

[0595] 本发明化合物 I 和组合物还可以具有植物增强作用。因此,它们适合调动植物的防御系统以对抗不希望的微生物如有害真菌以及病毒和细菌的侵袭。植物增强(诱发抗性)的物质在本发明上下文中应理解为指能够刺激被处理植物的防御系统以使得当随后被不希望的微生物接种时被处理植物对这些微生物显示出显著抗性的那些物质。

[0596] 化合物 I 可以用于在处理之后的一定时间内保护植物免受不希望的微生物侵袭。起保护作用的时间期限通常为用化合物 I 处理植物之后或处理种子之后的 1-28 天,优选 1-14 天,至多在播种之后 9 个月。

[0597] 本发明化合物 I 和组合物还适合提高收获产量。

[0598] 此外,它们具有降低的毒性且被植物良好耐受。

[0599] 下列实施例进一步说明本发明:

[0600] 适当改变原料,使用下列合成实施例所给程序得到其他化合物 I。以此方式得到的化合物与物理数据一起列于下表中。下面所示产物通过熔点的测定、NMR 光谱法或由 HPLC-MS 光谱法测定的质量 ($[m/z]$) 表征。

[0601] HPLC-MS = 与质谱法联用的高效液相色谱法:

[0602] HPLC 柱:RP-18 柱(来自德国 Merck KgaA 的 Chromolith Speed ROD), 50*4.6mm; 移动相:乙腈 +0.1% 三氟乙酸 (TFA)/ 水 +0.1% TFA, 在 40℃ 下在 5 分钟内使用 5:95-100:0 的梯度,流速:1.8ml/min。

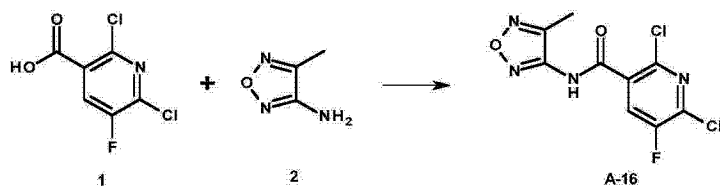
[0603] MS:四级杆电喷雾离子化,80V(正模式)。

[0604] DMAP:4-二甲氨基吡啶

[0605] EtOAc:乙酸乙酯

[0606] 实施例 1 : 2,6-二氯-5-氟-N-(4-甲基-1,2,5-噁二唑-3-基)吡啶-3-甲酰胺 (见表 12 的式 I.2 化合物, 其中 R、R³、R⁴ 和 R⁵ 对应于表 A 的 A-16 行=化合物 I.2-16)

[0607]

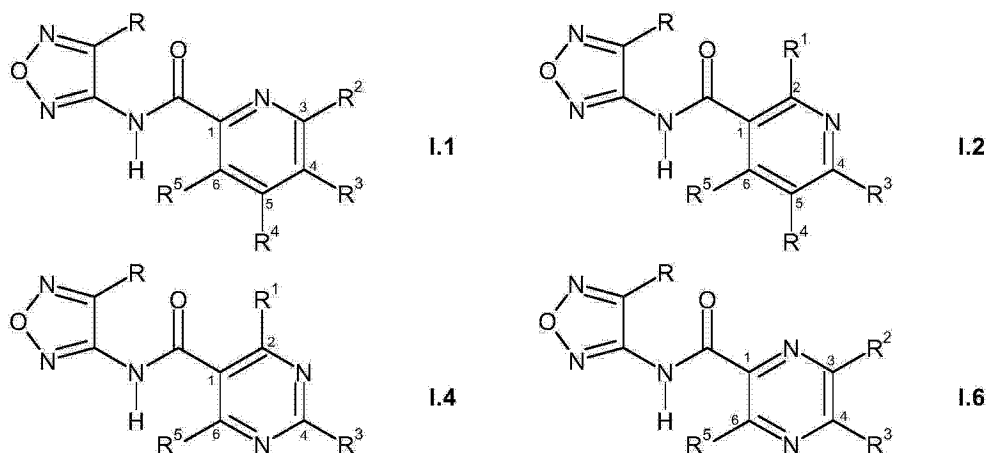


[0608] 在环境温度下向羧酸 1 (635mg, 3.0mmol) 和 4-甲基-1,2,5-噁二唑-3-胺 2 (300mg, 3.0mmol) 在 THF (80mL) 中的溶液中依次加入 Et₃N (0.44mL, 3.0mmol)、DMAP (74mg, 0.6mmol) 和聚磷酸酐 (≥ 50 重量%, 在 EtOAc 中, 1.55mL, 3.0mmol)。将该反应搅拌 18 小时, 然后减压浓缩。加入水 (200mL) 并将粗混合物静置 3 天。然后滗出水并将残余物溶于 CH₂Cl₂ 中, 干燥 (MgSO₄) 并浓缩, 得到 2,6-二氯-5-氟-N-(4-甲基-1,2,5-噁二唑-3-基)吡啶-3-甲酰胺 (430mg, 49%)。¹H NMR (CDCl₃, 400MHz): δ 8.91 (br. s, 1H), 8.14 (d, 1H), 2.47 (s, 3H)。

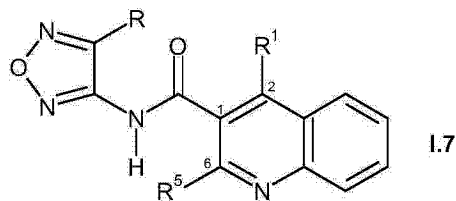
[0609] 通过类似于实施例 1 所述方法制备汇总于表 B-1 中的下列式 I.1、I.2、I.4、I.6 和 I.7 化合物:

[0610] 表 B-1 : 式 I.1、I.2、I.4、I.6 和 I.7 化合物

[0611]



[0612]



[0613]

化合物	式	R	R ¹ /R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	MS (m/z)
I.1-46	I.1	甲基	H	Cl	H	F	257.0

I. 1-49	I. 1	甲基	H	F	H	F	241.1
I. 1-91	I. 1	甲基	H	Cl	H	Cl	272.9
I. 1-93	I. 1	甲氧基	H	Cl	H	Cl	288.9
I. 1-97	I. 1	甲基	H	CF ₃	H	Cl	307.0
I. 1-136	I. 1	甲基	H	Cl	H	CF ₃	306.9
I. 2-1	I. 2	甲基	Cl	Cl	H	H	273.0
I. 2-7	I. 2	甲基	Cl	CF ₃	H	H	307.0
I. 2-16	I. 2	甲基	Cl	Cl	F	H	391.0
I. 4-178	I. 4	甲基	CF ₃	H	--	H	274.1
I. 6-31	I. 6	甲基	H	Cl	--	Cl	274.0
I. 7-7	I. 7	甲基	CF ₃	--	--	H	323.0

[0614] II. 应用实施例

[0615] 式 I 化合物的除草活性通过下列温室试验证实：

[0616] 所用培养容器为含有含约 3.0% 腐殖土的壤质砂作为底物的塑料花盆。对每一品种单独播种测试植物的种子。

[0617] 对于出苗前处理, 直接在播种之后借助细分布喷嘴施用悬浮或乳化于水中的活性成分。温和灌溉容器以促进发芽和生长, 然后用透明塑料罩覆盖, 直到植物生根。该覆盖导致测试植物均匀发芽, 除非被活性成分损坏。

[0618] 对于出苗后处理, 首先使测试植物生长到 3-15cm 的高度, 这取决于植物习性, 并仅在此时用悬浮或乳化于水中的活性成分处理。为此, 将测试植物直接播种并在相同容器中生长, 或者首先使它们作为秧苗单独生长并在处理之前几天移植到测试容器中。

[0619] 取决于品种, 将植物保持在 10-25℃ 或 20-35℃。测试期为 2-4 周。在此期间照料植物并评价它们对各处理的响应。

[0620] 使用 0-100 的评分进行评价。100 表示没有植物出苗, 或者至少地面上部分完全受损, 而 0 表示没有损害, 或者生长过程正常。对良好的除草活性给予至少 65 的分值, 而对非常好的除草活性给予至少 85 的分值。

[0621] 用于温室试验中的植物属于下列品种：

[0622]

Bayer 代码	学名	英文名
ABUTH	苘麻 (Abutilon theophrasti)	velvetleaf

AMARE	反枝苋 (<i>Amaranthus retroflexus</i>)	common amaranth
CHEAL	藜 (<i>Chenopodium album</i>)	lampsquaters
POLCO	金荞麦 (<i>Polygonum convolvulus</i>)	bindweed, black
SETVI	狗尾草 (<i>Setaria viridis</i>)	green foxtail

[0623] 在 1kg/ha 的施用率下,通过出苗后方法施用的化合物 I. 1-136 对 ABUTH 显示出非常好的除草活性。

[0624] 在 0.25kg/ha 的施用率下,通过出苗后方法施用的化合物 I. 4-178 对 ABUTH 显示出非常好的除草活性。

[0625] 在 1kg/ha 的施用率下,通过出苗后方法施用的化合物 I. 1-136 对 AMARE 显示出非常好的除草活性。

[0626] 在 0.25kg/ha 的施用率下,通过出苗前方法施用的化合物 I. 1-91 和 I. 2-7 对 AMARE 显示出良好至非常好的除草活性。

[0627] 在 0.25kg/ha 的施用率下,通过出苗后方法施用的化合物 I. 1-91、I. 1-93、I. 2-7 和 I. 4-178 对 AMARE 显示出非常好的除草活性。

[0628] 在 0.25kg/ha 的施用率下,通过出苗后方法施用的化合物 I. 1-91、I. 1-93、I. 1-97、I. 2-7 和 I. 4-178 对 CHEAL 显示出非常好的除草活性。

[0629] 在 0.25kg/ha 的施用率下,通过出苗后方法施用的化合物 I. 1-91 和 I. 2-7 对 POLCO 显示出良好至非常好的除草活性。

[0630] 在 0.25kg/ha 的施用率下,通过出苗后方法施用的化合物 I. 4-178 和 I. 2-7 对 SETVI 显示出非常好的除草活性。

[0631] 在 0.125kg/ha 的施用率下,通过出苗后方法施用的化合物 I. 6-31 对 AMARE 显示出良好的除草活性。

[0632] 在 0.125kg/ha 的施用率下,通过出苗后方法施用的化合物 I. 6-31 对 CHEAL 显示出良好的除草活性。