



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 113874372 A

(43) 申请公布日 2021. 12. 31

(21) 申请号 202080027284.7

(22) 申请日 2020.04.07

(30) 优先权数据

2019111014148 2019.04.08 IN

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2021.10.08

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/IB2020/053296 2020.04.07

(87) PCT国际申请的公布数据

W02020/208510 EN 2020.10.15

(71) 申请人 PI工业有限公司

地址 印度拉贾斯坦邦

(72) 发明人 帕拉斯·雷班·布加德

马鲁蒂·N·奈克

尼婷·拉梅什·滕巴哈雷

桑托什·什里达尔·奥特加

鲁芝·加尔嘉 维什瓦纳·加德

亚历山大·G·M·克劳泽纳

维桑纳加里·罗摩克里希纳

索尼亚利·斯万卡尔

维诺德·苏尼尔·瓦赫玛

(74) 专利代理机构 北京金信知识产权代理有限公司

11225

代理人 钱程 严彩霞

(51) Int. Cl.

C07D 471/04 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

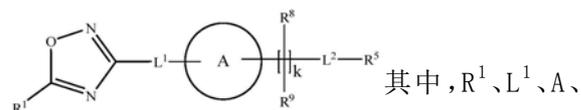
权利要求书27页 说明书93页

(54) 发明名称

用于控制或预防植物病原真菌的新型噁二唑化合物

(57) 摘要

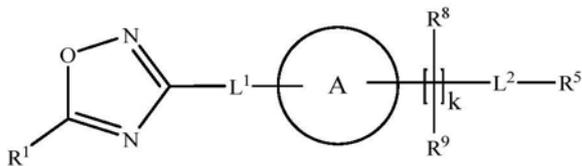
本发明公开了一种通式(I)的化合物,



通式 (I)

k、R⁸、R⁹、L²和R⁵如具体实施方式中所定义。本发明还公开了用于制备所述通式(I)的化合物的工艺。

1. 一种通式 (I) 的化合物,



通式 (I)

其中,

R^1 是 C_1 - C_2 -卤代烷基;

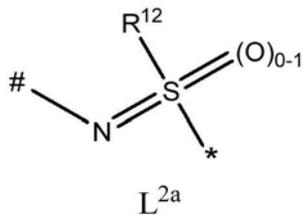
L^1 是直接键、 $-CR^2R^3-$ 、 $-C(=W^1)-$ 、 $-CR^2R^3C(=W^1)-$ 、 $-O-$ 、 $-S(=O)_{0-2}-$ 或 $-NR^{4a}-$; 其中, 基团开头和结尾的符号“-”表示与噁二唑环或A的连接点;

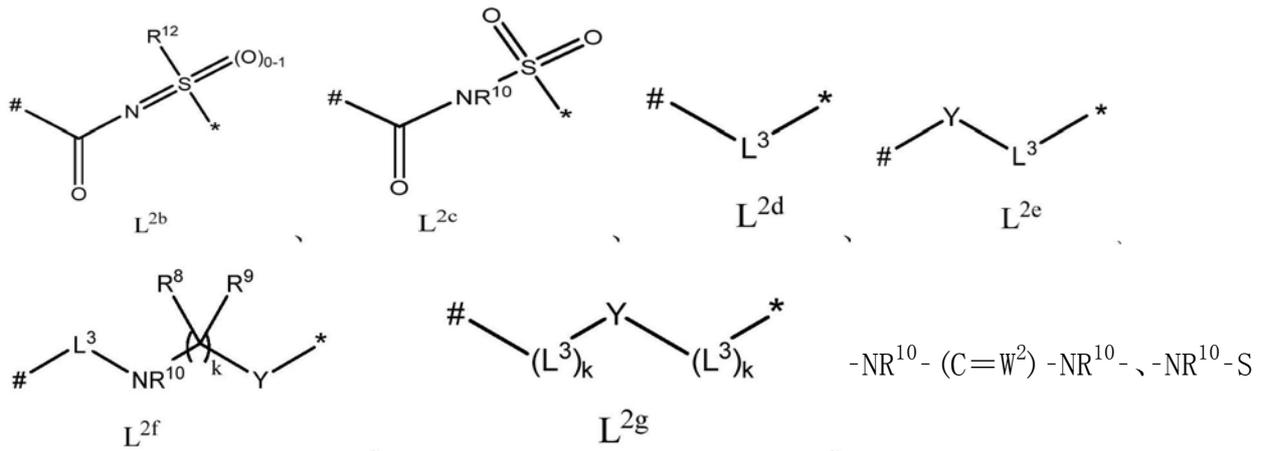
W^1 是O或S;

A是在一个或多个桥头处具有N的稠合杂双环; 其中所述环任选地被一个或多个相同或不同的 R^A 基团取代;

R^A 选自氢、卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、 SF_5 、 C_1 - C_6 -烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_3 - C_8 -环烷基、 C_3 - C_8 -环烷基烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_6 -羟基烷基、 C_2 - C_6 -卤代烯基、 C_1 - C_6 -卤代炔基、 C_3 - C_8 -卤代环烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -卤代烷氧基、 C_1 - C_6 -卤代烷氧基羰基、 C_1 - C_6 -烷基硫基、 C_1 - C_6 -卤代烷基硫基、 C_1 - C_6 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 -卤代烷基磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基氨基、 C_1 - C_6 -二烷基氨基、 C_3 - C_8 -环烷基氨基、 C_1 - C_6 -烷基- C_3 - C_8 -环烷基氨基、 C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基、 C_1 - C_6 -烷基氨基羰基、 C_1 - C_6 -二烷基氨基羰基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基氧基、 C_1 - C_6 -烷基氨基羰基氧基或 C_1 - C_6 -二烷基氨基羰基氧基、以及3-至6-元碳环或杂环, 其中, 所述3-至6-元碳环或杂环可以任选地被一个或多个相同或不同的取代基取代, 所述取代基选自卤素、氰基、硝基、羟基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_3 - C_8 -环烷基、 C_3 - C_8 -环烷基烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基烷基、 C_1 - C_6 -羟基烷基、 C_2 - C_6 -卤代烯基、 C_2 - C_6 -卤代炔基、 C_3 - C_6 -卤代环烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -烷基硫基、 C_1 - C_6 -卤代烷基硫基、 C_1 - C_6 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 -卤代烷基磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基氨基、二- C_1 - C_6 -烷基氨基、 C_3 - C_6 -环烷基氨基、 C_1 - C_6 -烷基- C_3 - C_6 -环烷基氨基、 C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基、 C_1 - C_6 -烷基氨基羰基、二- C_1 - C_6 -烷基氨基羰基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基氧基、 C_1 - C_6 -烷基氨基羰基氧基和二- C_1 - C_6 -烷基氨基羰基氧基;

L^2 为直接键或选自 $-C(=O)-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-O-$ 、 $-S(=O)_{0-2}-$ 、 $-NR^{10}-$ 、





(=O)₀₋₂-NR¹⁰-、-(C=W²)-NR¹⁰-NR¹⁰-、-S(=O)₀₋₂-NR¹⁰-NR¹⁰-、-NR¹⁰-NR¹⁰-(C=W²)-、-NR¹⁰-NR¹⁰-S(=O)₀₋₂-、-NR¹⁰-(C=W²)-NR¹⁰-NR¹⁰-、-NR¹⁰-S(=O)₀₋₂-NR¹⁰-NR¹⁰-、-NR¹⁰-NR¹⁰-(C=W²)-NR¹⁰-、-NR¹⁰-NR¹⁰-S(=O)₀₋₂-NR¹⁰-、-O(C=W²)-NR¹⁰-、以及-NR¹⁰-(C=W²)-O-；

Y是直接键或-NR¹⁰-、或-O-、或-S(O)₀₋₂-、或-C(=NOR¹¹)-；

k为0至4的整数；符号“-”、“#”和“*”表示连接点；

W²是O或S；

L³为直接键或选自-CR^{8a}R^{9a}-、-CR^{8a}R^{9a}C(=O)-、-C(=O)-、-C(=S)-、-O-、-S(=O)₀₋₂-、-S(O)₀₋₁(=NR¹⁰)-、-S(=N-CN)-、-S(=N-NO₂)-、-S(=N-COR^{8a})-、-S(=N-COOR¹¹)-、-S(=N-S(=O)₂R¹²)-、-NR¹⁰-、-NR¹⁰(C(=O))O-、以及-CR^{8a}(=N)O-；

R¹⁰选自氢、C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₁-C₆-烷氧基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烯基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₆-烷基、苯基-C₁-C₆-烷基、苯基、吡啶基、C(=O)-(C₁-C₆-烷基)、C(=O)-(C₁-C₆-烷氧基)和-N(R^{10a})₂；其中，R^{10a}选自氢、羟基、C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烯基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基和C₁-C₆-烷基硫基；每个R¹⁰基团任选地被选自卤素、羟基、氧代、氰基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基和C₃-C₆-环烷基的相同或不同基团取代；

R¹¹选自氢、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-环烷基、C₁-C₆-烷基硫基、C₃-C₈-环烯基、苯基-C₁-C₆-烷基、杂芳基-C₁-C₆-烷基、苯基和萘基；

R¹²选自氢，NR^gR^h，其中，R^g和R^h独立地选自氢、羟基、氰基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基和C₃-C₈-环烷基；(C=O)-Rⁱ，其中，Rⁱ选自氢、卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₁-C₄-卤代烷基、C₂-C₄-卤代烯基、C₂-C₄-卤代炔基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-卤代环烷基、C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷氧基；C₁₋₈-烷基-S(O)₀₋₂R^j，其中R^j选自氢、卤素、氰基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₃-C₈-环烷基；C₁-C₆-烷基-(C=O)-Rⁱ，CRⁱ=NR^g，C₁-C₆-烷基，C₂-C₆-烯基，C₂-C₆-炔基，C₁-C₆-卤代烷基，C₂-C₆-卤代烯基，C₂-C₆-卤代炔基，C₁-C₆-烷氧基，C₁-C₆-卤代烷氧基，C₃-C₈-环烷基，C₄-C₈-环烯基，C₇-C₁₉-芳烷基，双环C₅-C₁₂-烷基，C₇-C₁₂-烯基和稠合或非稠合或双环C₃-C₁₈-碳环或环系统；其中碳环或环系统的一个或多个C原子可以被N、O、S(=O)₀₋₂、S(=O)₀₋₁、(=NR¹⁰)、C(=O)、C(=S)、C(=CR⁸R⁹)和C=NR¹⁰代替；

R¹²可以任选地被一个或多个相同或不同的取代基取代，所述取代基选自氢、卤素、氰基、硝基、羟基、C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-环烷基、C₃-C₈-环烷基烷基、C₁-

C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₆-羟基烷基、C₂-C₆-卤代烯基、C₂-C₆-卤代炔基、C₃-C₈-卤代环烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基羰基、C₁-C₆-烷基硫基、C₁-C₆-卤代烷基硫基、C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₆-烷基氨基、二-C₁-C₆-烷基氨基、C₃-C₈-环烷基氨基、C₁-C₆-烷基-C₃-C₈-环烷基氨基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基、C₁-C₆-烷基氨基羰基、二-C₁-C₆-烷基氨基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基氧基、C₁-C₆-烷基氨基羰基氧基、二-C₁-C₆-烷基氨基羰基氧基、5-至11-元螺环和3-至6-元碳环或杂环；

R⁸和R⁹独立地选自氢、卤素、氰基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-环烷基、C₁-C₆-烷基硫基、C₃-C₈-环烯基、苯基-C₁-C₆-烷基、杂芳基-C₁-C₆-烷基、苯基、萘基和3-至10-元饱和、部分不饱和或芳族单-或双环碳环或杂环，其中，杂芳基-C₁-C₆-烷基的杂芳基和杂环的环成员包括C、N、O和S(O)₀₋₂，并且碳环或杂环的C环成员可以被一个或多个C(=O)和C(=S)替代；其中，R⁸和R⁹独立地被一个或多个相同或不同的R^{8a}或R^{9a}取代；其中R^{8a}和R^{9a}选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷基硫基、C₁-C₆-卤代烷基硫基、C₃-C₈-环烷基、氨基-C₁-C₆-烷基、二-C₁-C₆-烷基氨基、NHSO₂-C₁-C₆-烷基、-C(=O)-C₁-C₆-烷基、C(=O)-C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷基磺酰基、羟基-C₁-C₆-烷基、-C(=O)-NH₂、C(=O)-NH(C₁-C₆-烷基)、C₁-C₆-烷硫基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷基氨基-C₁-C₆-烷基、二-C₁-C₆-烷基氨基-C₁-C₆-烷基、氨基羰基-C₁-C₆-烷基和C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基；或者

R⁸和R⁹与它们所键合的原子一起形成C(=O)或乙烯基或饱和的单环3-至7-元杂环或碳环，其中，杂环的环成员包括C、N、O和S(O)₀₋₂；并且其中乙烯基、杂环或碳环未被取代或被一个或多个相同或不同的R^{8b}取代，其中R^{8b}选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷基硫基、C₁-C₆-卤代烷基硫基、C₃-C₈-环烷基、SO₂-C₁-C₆-烷基、NHSO₂-C₁-C₆-烷基、-C(=O)-C₁-C₆-烷基、C(=O)-C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷基磺酰基、SO₂-C₆H₄CH₃和SO₂-芳基；

R⁵选自氢、C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₁-C₆-卤代烷基、C₂-C₆-卤代烯基、C₂-C₆-卤代炔基、C₃-C₈-环烷基、C₃-C₈-卤代环烷基、C₁-C₆-烷基-C₃-C₈-环烷基、C₃-C₈-环烷基-C₁-C₆-烷基、C₃-C₈-环烷基-C₃-C₈-环烷基、C₃-C₈-卤代环烷基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷基-C₃-C₈-环烷基-C₁-C₆-烷基、C₃-C₈-环烯基、C₃-C₈-卤代环烯基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₃-C₈-环烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷基-C₁-C₆-硫基烷基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷基磺酰基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷基氨基、二-C₁-C₆-烷基氨基、C₁-C₆-烷基氨基-C₁-C₆-烷基、二-C₁-C₆-烷基氨基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基氨基-C₁-C₆-烷基、C₃-C₈-环烷基氨基、C₃-C₈-环烷基氨基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-卤代烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-羟基烷基、C₂-C₆-羟基烯基、C₂-C₆-羟基炔基、C₃-C₈-卤代环烷氧基、C₃-C₈-环烷基-C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆-烯基氧基、C₂-C₆-卤代烯基氧基、C₂-C₆-炔基氧基、C₂-C₆-卤代炔基氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷基羰基烷氧基、C₁-C₆-烷基硫基、C₁-C₆-卤代烷基硫基、C₃-C₈-环烷基硫基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基、C₃-C₈-环烷基磺酰基、C₃-C₈-环烷基亚磺酰基、三-C₁-C₆-烷基甲硅烷基、C₁-C₆-烷基磺酰基氨基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基氨基、C₁-C₆-烷基羰基硫基、C₁-C₆-烷基磺酰基氧基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基氧基、C₆-C₁₀-芳基

磺酰基氧基、 C_6-C_{10} -芳基亚磺酰基氧基、 C_6-C_{10} -芳基磺酰基、 C_6-C_{10} -芳基亚磺酰基、 C_6-C_{10} -芳基硫基、 C_1-C_6 -氰基烷基、 C_2-C_6 -烯基羰基氧基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基硫基、 C_1-C_6 -烷基硫基- C_1-C_6 -烷氧基、 C_2-C_6 -卤代烯基羰基氧基、 C_1-C_6 -烷氧基羰基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_2-C_6 -炔基、 C_2-C_6 -炔基硫基、 C_3-C_8 -卤代环烷基羰基氧基、 C_2-C_6 -烯基氨基、 C_2-C_6 -炔基氨基、 C_1-C_6 -卤代烷基氨基、 C_3-C_8 -环烷基- C_1-C_6 -烷基氨基、 C_1-C_6 -烷氧基氨基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基氨基、 C_1-C_6 -烷氧基羰基氨基、 C_1-C_6 -烷基羰基- C_1-C_6 -烷基氨基、 C_1-C_6 -卤代烷基羰基- C_1-C_6 -烷基氨基、 C_1-C_6 -烷氧基羰基- C_1-C_6 -烷基氨基、 C_2-C_6 -烯基硫基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基羰基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基羰基氨基、二(C_1-C_6 -卤代烷基)氨基- C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_8 -卤代环烯基氧基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基(C_1-C_6 -烷基)氨基羰基、 C_1-C_6 -卤代烷基磺酰基氨基羰基、 C_1-C_6 -烷基磺酰基氨基羰基、 C_1-C_6 -烷氧基羰基烷氧基、 C_1-C_6 -烷基氨基硫基羰基氨基、 C_3-C_8 -环烷基- C_1-C_6 -烷基氨基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷基硫基羰基、 C_3-C_8 -环烯基氧基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷氧基羰基、二- C_1-C_6 -烷基氨基硫基羰基氨基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基- C_1-C_6 -卤代烷氧基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -卤代烷氧基、 C_3-C_8 -卤代环烷氧基- C_1-C_6 -烷基、二- C_1-C_6 -烷基氨基羰基氨基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_2-C_6 -烯基、 C_1-C_6 -烷基硫基羰基氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基- C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷基磺酰基氧基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -卤代烷基、二(C_1-C_6 -卤代烷基)氨基、二- C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷基氨基羰基氨基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基- C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷基氨基羰基- C_1-C_6 -烷基氨基、三- C_1-C_6 -烷基甲硅烷基- C_2-C_6 -炔基氧基、三- C_1-C_6 -烷基甲硅烷基氧基、三- C_1-C_6 -烷基甲硅烷基- C_2-C_6 -炔基、氰基(C_1-C_6 -烷氧基)- C_1-C_6 -烷基、二- C_1-C_6 -烷基硫基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基磺酰基、 C_3-C_8 -卤代环烷氧基羰基、 C_1-C_6 -烷基- C_3-C_8 -环烷基羰基、 C_3-C_8 -卤代环烷基羰基、 C_2-C_6 -烯基氧基羰基、 C_2-C_6 -炔基氧基羰基、 C_1-C_6 -氰基烷氧基羰基、 C_1-C_6 -烷基硫基- C_1-C_6 -烷氧基羰基、 C_2-C_6 -炔基羰基氧基、 C_2-C_6 -卤代炔基羰基氧基、氰基羰基氧基、 C_1-C_6 -氰基烷基羰基氧基、 C_3-C_8 -环烷基磺酰基氧基、 C_3-C_8 -环烷基- C_1-C_6 -烷基磺酰基氧基、 C_3-C_8 -卤代环烷基磺酰基氧基、 C_2-C_6 -烯基磺酰基氧基、 C_2-C_6 -炔基磺酰基氧基、 C_1-C_6 -氰基烷基磺酰基氧基、 C_2-C_6 -卤代烯基磺酰基氧基、 C_2-C_6 -卤代炔基磺酰基氧基、 C_2-C_6 -炔基环烷氧基、 C_2-C_6 -氰基烯基氧基、 C_2-C_6 -氰基炔基氧基、 C_1-C_6 -烷氧基羰基氧基、 C_2-C_6 -烯基氧基羰基氧基、 C_2-C_6 -炔基氧基羰基氧基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基羰基氧基、硫亚胺、亚砷亚胺和 SF_5 或 Z^1Q^1 ; R^5 可以任选地被一个或多个 R^6 取代;

Z^1 是直接键、 $CR^{2a}R^{3a}$ 、N、O、C(O)、C(S)、C(=CR^{2a}R^{3a})或S(O)₀₋₂;

Q^1 选自苯基、苄基、萘基、5-或6-元芳族环、8-至11-元芳族多环系统、8-至11-元芳族稠合环系统、5-或6-元杂芳族环、8-至11-元杂芳族多环系统和8-至11-元杂芳族稠合环系统;其中杂芳族环的杂原子选自N、O或S,并且每个环或环系统可以任选地被一个或多个独立地选自 R^{13} 的取代基取代;或者

Q^1 选自3-至7-元非芳族碳环、4-、5-、6-或7-元非芳族杂环、8-至15-元非芳族多环系统、5-至15-元螺环系统、8-至15-元非芳族稠合环系统,其中,非芳族环的杂原子选自N、O或S(O)₀₋₂,且非芳族碳环或非芳族杂环或环系统的C环成员可以用C(O)、C(S)、C(=CR^{2b}R^{3b})或C(=NR^{4b})代替,并且每个环或环系统可以任选地被一个或多个独立地选自 R^{13} 的取代基取代;

R^2 、 R^3 、 R^{2a} 、 R^{3a} 、 R^{2b} 和 R^{3b} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_2-C_4 -炔基,

C₆-烷基硫基羰基、C₃-C₈-环烯基氧基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷氧基羰基、二-C₁-C₆-烷基氨基硫基羰基氨基、C₁-C₆-卤代烷氧基-C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-卤代烷氧基、C₃-C₈-卤代环烷氧基-C₁-C₆-烷基、二-C₁-C₆-烷基氨基羰基氨基、C₁-C₆-烷氧基-C₂-C₆-烯基、C₁-C₆-烷基硫基羰基氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基-C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-卤代烷基、二(C₁-C₆-卤代烷基)氨基、二-C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷基氨基羰基氨基、C₁-C₆-卤代烷氧基-C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷基氨基羰基-C₁-C₆-烷基氨基、三-C₁-C₆-烷基甲硅烷基-C₂-C₆-炔基氧基、三-C₁-C₆-烷基甲硅烷基氧基、三-C₁-C₆-烷基甲硅烷基-C₂-C₆-炔基、氰基(C₁-C₆-烷氧基)-C₁-C₆-烷基、二-C₁-C₆-烷基硫基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基磺酰基、C₃-C₈-卤代环烷氧基羰基、C₁-C₆-烷基-C₃-C₈-环烷基羰基、C₃-C₈-卤代环烷基羰基、C₂-C₆-烯基氧基羰基、C₂-C₆-炔基氧基羰基、C₁-C₆-氰基烷氧基羰基、C₁-C₆-烷基硫基-C₁-C₆-烷氧基羰基、C₂-C₆-炔基羰基氧基、C₂-C₆-卤代炔基羰基氧基、氰基羰基氧基、C₁-C₆-氰基烷基羰基氧基、C₃-C₈-环烷基磺酰基氧基、C₃-C₈-环烷基-C₁-C₆-烷基磺酰基氧基、C₃-C₈-卤代环烷基磺酰基氧基、C₂-C₆-烯基磺酰基氧基、C₂-C₆-炔基磺酰基氧基、C₁-C₆-氰基烷基磺酰基氧基、C₂-C₆-卤代烯基磺酰基氧基、C₂-C₆-卤代炔基磺酰基氧基、C₂-C₆-炔基环烷氧基、C₂-C₆-氰基烯基氧基、C₂-C₆-氰基炔基氧基、C₁-C₆-烷氧基羰基氧基、C₂-C₆-烯基氧基羰基氧基、C₂-C₆-炔基氧基羰基氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基羰基氧基、磺亚胺、亚砷亚胺和SF₅;

和/或其N-氧化物、金属络合物、异构体、多晶型物或农业上可接受的盐;

条件是以下化合物被排除在通式(I)化合物的定义之外;

N-(2-甲氧基乙基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺和6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯。

2. 根据权利要求1所述的通式(I)的化合物,其中

R¹选自CF₃、CHF₂、CF₂Cl、CF₂CF₃、CH₂F、CH₂CF₃、CHClCF₃和CCl₂CF₃;

L¹是直接键,-CR²R³-;

A是在一个或多个桥头处具有N的稠合杂双环;其中所述环任选地被一个或多个相同或不同的R^A基团取代;

R^A选自氢、卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、SF₅、C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-环烷基、C₃-C₈-环烷基烷基和C₁-C₆-卤代烷基;

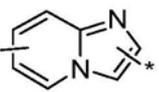
R⁸和R⁹独立地选自氢、卤素、氰基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-环烷基和C₁-C₆-烷基硫基;或者

R⁸和R⁹与它们所键合的原子一起形成C(=O)或乙烯基或饱和的单环3-至7-元杂环或碳环,其中,杂环的环成员包括C、N、O和S(O)₀₋₂;并且其中乙烯基、杂环或碳环未被取代或被一个或多个相同或不同的R^{8b}取代,其中R^{8b}选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷基硫基、C₁-C₆-卤代烷基硫基和C₃-C₈-环烷基。

3. 根据权利要求1所述的通式(I)的化合物,其中

R¹选自CF₃、CHF₂、CF₂Cl、CHClCF₃和CCl₂CF₃;

L¹是直接键;

A是#; 其中“#”和“*”表示连接点并且所述环任选地被一个或多个相同或不

同的R^A基团取代;

R^A选自氢、卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、SF₅、C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-环烷基、C₃-C₈-环烷基烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₄-烷基和C₁-C₆-羟基烷基;

R⁸和R⁹独立地选自氢、卤素、氰基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基和C₃-C₈-环烷基;或者

R⁸和R⁹与它们所结合的原子一起形成C(=O)或乙烯基。

4. 根据权利要求1所述的通式(I)的化合物,其中所述通式(I)的化合物选自:

N-(3-甲氧基苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(4-甲氧基苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(对甲苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(3-氟苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(2,4-二氟苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(4-氯苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(2-氟苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(4-(三氟甲基)苄基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(吡啶-3-基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-苄基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(吡啶-4-基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(4-氯苯基)-N-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-甲基-N-(2-苯氧基乙基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(4-氰基苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(3-甲氧基苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(2,4-二氟苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(4-氯苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(对甲苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(2-氟苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(4-甲氧基苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-苄基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(3-氟苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N,N-二甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(4-氯-2-氟苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(4-氰基苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(2-甲氧基苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(吡啶-3-基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(2,6-二氟苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(3-氟苄基)-6-(5-

(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(吡啶-4-基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;氮杂环丁烷-1-基(7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲酮;N-(2-甲氧基乙基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-异丁基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-新戊基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-异戊基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(4-氯苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(4-甲氧基苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(3-氯苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(3-甲氧基苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(2-氟苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(4-(二甲基氨基)苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(3,4-二氯苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯氢溴酸盐;3-(2-(((3-甲氧基苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-氯苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-氟苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-甲氧基苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((苯基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((2-氟苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;5-(三氟甲基)-3-(2-(((4-(三氟甲基)苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-甲氧基苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((丙基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-氯苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-甲氧基苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-氟苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((苯基磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((2-氟苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-甲氧基苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((丙基磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;5-(三氟甲基)-3-(2-(((4-(三氟甲基)苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-1,2,4-噁二唑;6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(4-(三氟甲基)苄基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;吗啉(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲酮;N-(2-甲氧基乙基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-异丁基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-环戊基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;(3-甲氧基吡咯烷-1-基)(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲酮;氮杂环丁烷-1-基(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-

基)甲酮;N-(环丙基甲基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-苄基-N-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(1-苄基乙基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(1-氰基环丙基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(2-甲氧基乙基)-N-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(3-氯苄基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(3-甲氧基苄基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(4-氯苄基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-异丁基-N-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯;3-(2-(乙氧基甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;4-甲氧基-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;4-氯-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;2-(4-氯苄基)-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)乙酰胺;3-氯-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;3,4-二氯-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)吡啶酰胺;N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)丙酰胺;4-(三氟甲氧基)-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;4-氟-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;2-氟-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)噁唑-4-甲酰胺;3-氟-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;2-苄基-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)乙酰胺;4-(二甲基氨基)-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;3-甲基-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)丁酰胺;4-(三氟甲基)-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)烟酰胺;N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)异烟酰胺;3-(2-((4-甲氧基苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((苄基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((4-氯苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((3-氯苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((3-氟苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((4-氟苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((2-氟苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((丙基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-

(2-((苄基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-甲氧基苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((3,4-二氯苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((3,5-二氯苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((异丁基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((环戊基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((环己基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((2-乙基苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((苄基磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((3,4-二氯苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((3-氯苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-氯苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((3-氟苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-氟苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-甲氧基苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((环己基磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((2-氟苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-甲氧基苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((3,4-二氯苄基)亚磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((3-氯苄基)亚磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((2-氟苄基)亚磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;N-(甲基(氧代)(苄基)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(2-氟苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(3-氟苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(4-氟苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(3-甲氧基苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(二甲基(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(1-氧代四氢-2H-1 λ^6 -噻喃-1-亚基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(4-氯苄基)(2-甲氧基乙基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(异丙基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(4-甲氧基苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(甲基(氧代)(4-(三氟甲基)苄基)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(3,5-二氯苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(1-氧代四氢-1 λ^6 -噻吩-1-亚基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并

[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-((4-溴苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-((3,4-二氯苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(4-氧代-1,4 λ^6 -氧硫杂环己烷-4-亚基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-((2-甲氧基苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-((4-甲氧基吡啶-2-基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-((4-氯苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(甲基(氧代)(邻甲苯基)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-((3-氯苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;(3-氟苯基)(甲基)((2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)丁酰胺;亚氨基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砷;N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)新戊酰胺;4-甲氧基-N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺;N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺;4-氯-2-氟-N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺;3-氟-N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺;3-氯-N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺;4-氯-N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺;N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)-4-(三氟甲氧基)苯甲酰胺;N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)-2-(三氟甲基)苯甲酰胺;N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)-3-(三氟甲基)苯甲酰胺;2-氟-N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺;亚氨基(苯基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砷;亚氨基(4-甲氧基苯基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砷;(4-氯苯基)(亚氨基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砷;(4-氟苯基)(亚氨基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砷;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(4-甲氧基苄基)(甲基)- λ^6 -亚砷;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)((1-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基)- λ^6 -亚砷;(4-氯苄基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砷;((7-(5-(氯

二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(甲基)((1-甲基-1H-1,2,4-三唑-3-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(甲基)(苯基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(2,4-二氟苯基)(甲基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(4-氟苯基)(甲基)- λ^6 -亚砜;叔丁基((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(甲基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(甲基)(3,3,3-三氟丙基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(甲基)((1-甲基-1H-咪唑-4-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)二甲基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(环丙基甲基)(甲基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(2,6-二氯苯基)(甲基)- λ^6 -亚砜;(2-氯-4-氟苯基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(甲基)- λ^6 -亚砜;(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(甲基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(甲基)(4-(三氟甲氧基)苯基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(甲基)(4-甲基苄基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(4-甲氧基苄基)(甲基)- λ^6 -亚砜;苄基((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(甲基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(甲基)(吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(异噁唑-4-基甲基)(甲基)- λ^6 -亚砜;((1,2,4-噁二唑-3-基)甲基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(甲基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(甲基)(噁唑-4-基甲基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(甲基)(噁唑-4-基甲基)- λ^6 -亚砜;(2-氯-6-甲氧基苯基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(甲基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(甲基)(噁唑-5-基)- λ^6 -亚砜;(3-氯-4-(三氟甲基)苯基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(甲基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(异丙基)(甲基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(乙基)(甲基)- λ^6 -亚砜;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基(2-甲氧基乙基)(甲基)- λ^6 -亚砜;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-((4-甲氧基苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;N-((4-氯苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,

2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基((1-甲基-1H-1,2,4-三唑-3-基)甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基(氧代)(苯基)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-((2,4-二氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-((4-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;N-(叔丁基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基(氧代)(3,3,3-三氟丙基)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基((1-甲基-1H-咪唑-4-基)甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(二甲基(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-((环丙基甲基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-((2,6-二氯苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;N-((2-氯-4-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-((2-氯-4-(三氟甲基)苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基(氧代)(4-(三氟甲氧基)苯基)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基(4-甲基苄基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-((4-甲氧基苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;N-(苄基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基(氧代)(吡啶-3-基)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-((异噁唑-4-基甲基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;N-(((1,2,4-噁二唑-3-基)甲基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基(噁唑-4-基甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基(氧代)(噁唑-4-基甲基)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;N-((2-氯-6-甲氧基苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基(氧代)(噁唑-5-基)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;N-((3-氯-4-(三氟甲基)苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(异丙基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(乙基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-((2-甲氧基乙

基) (甲基) (氧代) - λ^6 -亚硫基) 乙酰胺; 2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基((1-甲基-1H-吡唑-4-基)甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺; 7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(甲基(氧代)(苯基)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺; 7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-((4-氯苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺; 7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-((4-甲氧基苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺; 7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(甲基(氧代)(间甲苯基)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺; 7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-((2-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺; 7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-((2,4-二氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺; 7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-((3-(二甲基氨基)苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺; 7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(二甲基(氧代)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺; 7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(乙基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺; N-(叔丁基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺; 7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-((环丙基甲基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺; N-(苄基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺; 7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(甲基(氧代)(咪唑-5-基)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺; 7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(甲基(氧代)(哒嗪-4-基)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺; 7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(甲基(氧代)(吡嗪-2-基)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺; 7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(甲基(氧代)(吡啶-4-基)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺; (((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(4-甲氧基苄基)(甲基)- λ^6 -亚砷; (((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)((1-甲基-1H-吡唑-4-基)甲基)- λ^6 -亚砷; (4-氯苄基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砷; (((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)((1-甲基-1H-1,2,4-三唑-3-基)甲基)- λ^6 -亚砷; (((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)(苯基)- λ^6 -亚砷; (((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(2,4-二氟苯基)(甲基)- λ^6 -亚砷; (((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(4-氟苯基)(甲基)- λ^6 -亚砷; 叔丁基(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砷; (((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)(3,3,3-三氟丙基)- λ^6 -亚砷; (((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)((1-甲基-1H-咪唑-4-基)甲基)- λ^6 -亚砷; (((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)二甲基- λ^6 -亚砷; (((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(环丙基甲基)(甲基)-

λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(2,6-二氯苯基)(甲基)- λ^6 -亚砒;(2-氯-4-氟苯基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砒;(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)(4-(三氟甲氧基)苯基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)(4-甲基苄基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(4-甲氧基苯基)(甲基)- λ^6 -亚砒;苄基(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)(吡啶-3-基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(异噁唑-4-基甲基)(甲基)- λ^6 -亚砒;((1,2,4-噁二唑-3-基)甲基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)(噁唑-4-基甲基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)(噁唑-4-基甲基)- λ^6 -亚砒;(2-氯-6-甲氧基苯基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)(嘧啶-5-基)- λ^6 -亚砒;(3-氯-4-(三氟甲基)苯基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(异丙基)(甲基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(乙基)(甲基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(2-甲氧基乙基)(甲基)- λ^6 -亚砒;(4-甲氧基苄基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砒;甲基((1-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砒;(4-氯苄基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砒;甲基((1-甲基-1H-1,2,4-三唑-3-基)甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砒;甲基((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(苯基)- λ^6 -亚砒;(2,4-二氟苯基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砒;(4-氟苯基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砒;叔丁基(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砒;甲基((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(3,3,3-三氟丙基)- λ^6 -亚砒;甲基((1-甲基-1H-咪唑-4-基)甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砒;二甲基((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-

基)亚氨基)- λ^6 -亚砜; (环丙基甲基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜; (2,6-二氯苯基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜; (2-氯-4-氟苯基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜; (2-氯-4-(三氟甲基)苯基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜; 甲基((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(4-(三氟甲氧基)苯基)- λ^6 -亚砜; 甲基((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(4-甲基苄基)- λ^6 -亚砜; (4-甲氧基苄基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜; 苄基(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜; 甲基((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜; (异噁唑-4-基甲基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜; ((1,2,4-噁二唑-3-基)甲基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜; 甲基((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(噁唑-4-基甲基)- λ^6 -亚砜; (2-氯-6-甲氧基苄基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜; 甲基((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(噁唑-5-基)- λ^6 -亚砜; (3-氯-4-(三氟甲基)苄基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜; 异丙基(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜; 乙基(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜; (2-甲氧基乙基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜; (异丙基亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜; ((环丙基甲基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜; ((异噁唑-4-基甲基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜; ((2-甲氧基乙基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜; 甲基(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)(甲基亚氨基)- λ^6 -亚砜; (乙基亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜; 甲基(((1-甲基-1H-咪唑-4-基)甲基)亚氨基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜; 甲基(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)((3,3,3-三氟丙基)亚氨基)- λ^6 -亚砜; ((4-甲氧基苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜; 甲基(((1-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基)亚氨基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;

((4-氯苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;甲基(((1-甲基-1H-1,2,4-三唑-3-基)甲基)亚氨基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;甲基(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)(苯基亚氨基)- λ^6 -亚砜;((2,4-二氟苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((4-氟苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((叔丁基亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;甲基(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)(吡啶-3-基亚氨基)- λ^6 -亚砜;((苄基亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((4-甲氧基苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;甲基(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)((4-三氟甲氧基)苄基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;((2-氯-4-(三氟甲基)苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((2-氯-4-氟苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((2,6-二氯苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((2-氯-6-甲氧基苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;甲基(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)((噁唑-4-基甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)((噁唑-4-基甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(((1,2,4-噁二唑-3-基)甲基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;甲基(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)(噁唑-5-基亚氨基)- λ^6 -亚砜;((3-氯-4-(三氟甲基)苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((异丙基亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((环丙基甲基)亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((异噁唑-4-基甲基)亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((2-甲氧基乙基)亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基(甲基亚氨基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((乙基亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基(((1-甲基-1H-咪唑-4-基)甲基)亚氨基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)((3,3,3-三氟丙基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;((4-甲氧基苄基)亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基(((1-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基)亚氨基

基) ((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;
(4-氯苄基)亚氨基(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡
啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基(((1-甲基-1H-1,2,4-三唑-3-基)甲基)亚氨基)((6-(5-(三
氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基(苯基亚氨
基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;
(2,4-二氟苯基)亚氨基(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]
吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((4-氟苯基)亚氨基(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二
唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;叔丁基亚氨基(甲基)((6-(5-(三氟
甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基(吡啶-3-基亚
氨基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚
砜;苄基亚氨基(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-
基)甲基)- λ^6 -亚砜;((4-甲氧基苯基)亚氨基(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-
3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基((4-甲基苄基)亚氨基)((6-(5-(三
氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基((4-(三氟
甲氧基)苯基)亚氨基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-
基)甲基)- λ^6 -亚砜;((2-氯-4-(三氟甲基)苯基)亚氨基(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,
4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((2-氯-4-氟苯基)亚氨基(甲
基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;
(2,6-二氯苯基)亚氨基(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]
吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((2-氯-6-甲氧基苯基)亚氨基(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,
2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基((噻唑-4-基甲基)亚氨
基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;
甲基((噁唑-4-基甲基)亚氨基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]
吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;(((1,2,4-噁二唑-3-基)甲基)亚氨基(甲基)((6-(5-(三氟甲
基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基(噁唑-5-基亚氨
基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;
(3-氯-4-(三氟甲基)苯基)亚氨基(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑
并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;N-(甲基(氧代)(苯基)- λ^6 -亚砜基)-7-(5-(三氟甲
基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-((4-氯苯基)(甲基)(氧代)-
 λ^6 -亚砜基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-
(4-甲氧基苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚砜基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑
并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(甲基(氧代)(间甲苯基)- λ^6 -亚砜基)-7-(5-(三氟甲基)-1,
2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-((2-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚砜
基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-((2,4-二氟
苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚砜基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]
吡啶-2-甲酰胺;N-((3-(二甲基氨基)苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚砜基)-7-(5-(三氟甲基)-
1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(二甲基(氧代)- λ^6 -亚砜基)-7-(5-
(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(乙基(甲基)(氧代)-
 λ^6 -亚砜基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(叔

丁基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-((环丙基甲基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(苄基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(甲基(氧代)(咪啉-5-基)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(甲基(氧代)(哒嗪-4-基)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(甲基(氧代)(吡啶-2-基)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(甲基(氧代)(吡啶-4-基)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;甲基(苯基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(4-氟苯基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(4-甲氧基苯基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(间甲苯基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(2-氟苯基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(2,4-二氟苯基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(3-(二甲氨基)苯基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;二甲基((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;乙基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;叔丁基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(环丙基甲基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;苄基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(咪啉-5-基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(哒嗪-4-基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(吡啶-2-基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(吡啶-4-基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(苯基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(3-甲基苄基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(吡啶-4-基甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(咪啉-4-基甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(吡啶-3-基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(吡啶-2-基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)(5-(三氟甲基)吡啶-2-基)- λ^6 -亚砜;(5-甲氧基吡啶-2-基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(5-氟吡啶-2-基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并

[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(咪啶-5-基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(哒嗪-4-基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(1-甲基-1H-吡啶-4-基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;异噁唑-4-基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(2-甲氧基噻唑-4-基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;二甲基((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;乙基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;叔丁基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(环丙基甲基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(3,3,3-三氟丙基)- λ^6 -亚砜;(2-甲氧基乙基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;苄基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(3-甲氧基苄基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(3-氟苄基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;异丙基(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(环丙基甲基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(异噁唑-4-基甲基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(2-甲氧基乙基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;二甲基((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;乙基(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((1-甲基-1H-咪唑-4-基)甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(3,3,3-三氟丙基)- λ^6 -亚砜;(4-甲氧基苄基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((1-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(4-氟苄基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((1-甲基-1H-1,2,4-三唑-3-基)甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(苯基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(2,4-二氟苯基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(4-氟苯基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;叔丁基(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并

[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;甲基(吡啶-3-基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;苄基(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;(4-甲氧基苯基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;甲基(4-甲基苄基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;甲基(4-(三氟甲氧基)苯基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;(2-氯-4-氟苯基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;(2,6-二氯苯基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;(2-氯-6-甲氧基苯基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;甲基(噁唑-4-基甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;甲基(噁唑-4-基甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;((1,2,4-噁二唑-3-基)甲基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;甲基(噁唑-5-基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷和(3-氯-4-(三氟甲基)苯基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷。

5. 根据权利要求1所述的通式(I)的化合物,其中,所述化合物用作杀真菌剂。

6. 一种组合,其包含根据权利要求1所述的通式(I)的化合物和至少一种选自杀真菌剂、杀虫剂、杀线虫剂、杀螨剂、生物杀虫剂、除草剂、安全剂、植物生长调节剂、抗生素、肥料和营养素的其他农药活性物质。

7. 一种用于控制或预防植物病害的组合物,其包含根据权利要求1所述的通式(I)的化合物和至少一种农业化学上可接受的辅料。

8. 根据权利要求7所述的组合物,其中,所述组合物可进一步包含至少一种其他活性成分。

9. 根据权利要求7所述的组合物,其中,所述组合物被施用于种子,且在所述组合物中,通式(I)所述的化合物的量为每100kg种子0.1gai至10kgai。

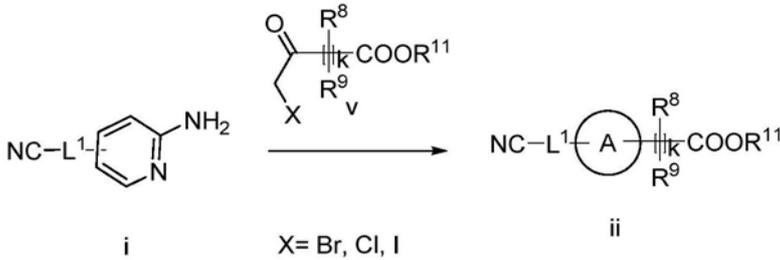
10. 根据权利要求7所述的组合物,其中,所述植物病害是由锈病病原体引起的,所述锈病病原体选自各种植物上的咖啡驼孢锈菌(咖啡锈病)、疣顶/蚕豆/菜豆单胞锈菌(豆锈病),选自在选自小麦、大麦或黑麦的禾谷类上的小麦柄锈菌(褐锈病或叶锈病)、条形柄锈菌(条锈病或黄锈病)、大麦柄锈菌(矮锈病)、禾柄锈菌(茎锈病或黑锈病)或隐匿柄锈菌(褐锈病或叶锈病),和在各种植物上的层锈菌,特别是大豆上的豆薯层锈菌和山马蟥层锈菌(大豆锈病)。

11. 一种控制或预防植物病原真菌的方法,其中该方法包括用有效量的至少一种根据权利要求1所述的通式(I)的化合物、根据权利要求6所述的组合或根据权利要求7所述的组合物处理真菌或要被保护以防止真菌侵袭的材料、植物、植物部分、其场所、土壤或种子。

12. 一种控制或预防植物病原微生物在农作物和/或园艺作物中侵染植物的方法, 其中将有效量的至少一种根据权利要求1所述的通式(I)的化合物、根据权利要求6所述的组合或根据权利要求7所述的组合物施用于植物种子。

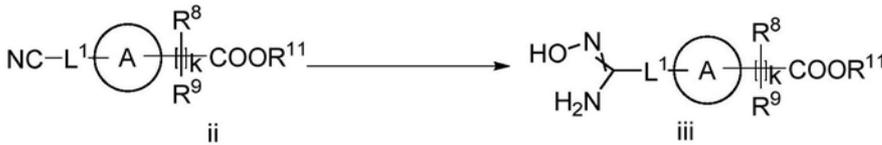
13. 一种根据权利要求1所述的通式(I)的化合物的制备方法, 其中, 所述方法包括以下步骤:

a) 使式i的化合物与式v的 α -卤代羧基化合物反应以得到式ii化合物;



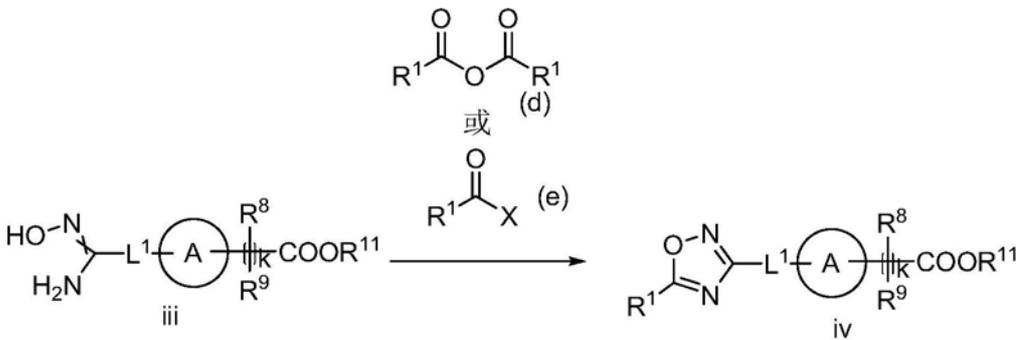
其中, L^1 是直接键; 且A是 # ,

b) 使式ii化合物与羟胺反应以得到式iii化合物;



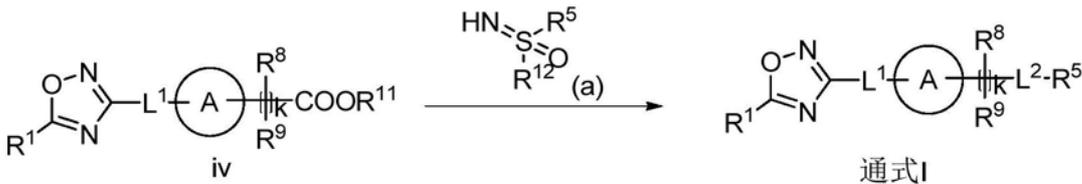
其中, L^1 是直接键; 且A是 # ,

c) 使式iii化合物与式(d)的酸酐或式(e)的酰氯化合物反应以得到式iv化合物;



其中, L^1 是直接键; A是 # ; 且X是Cl、Br或I,

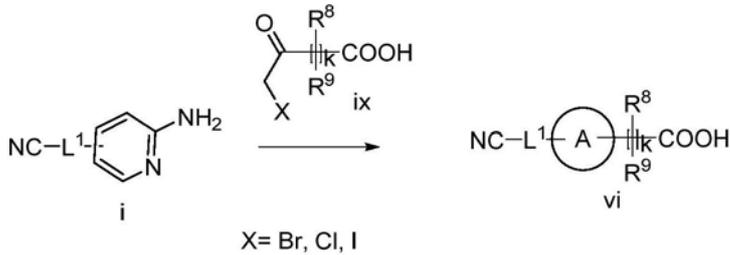
d) 使式iv化合物与式(a)的亚砷亚胺化合物反应得到通式(I)化合物;



其中, L^1 是直接键; 且A是 # .

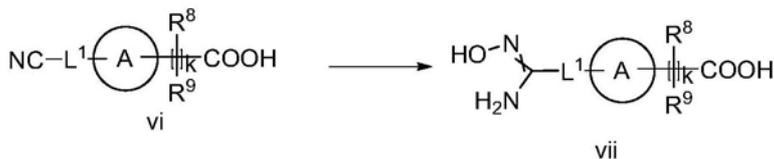
14. 一种根据权利要求1所述的通式(I)的化合物的制备方法,其中,所述方法包括以下步骤:

a) 使式i的化合物与式ix的化合物反应以得到式vi化合物;



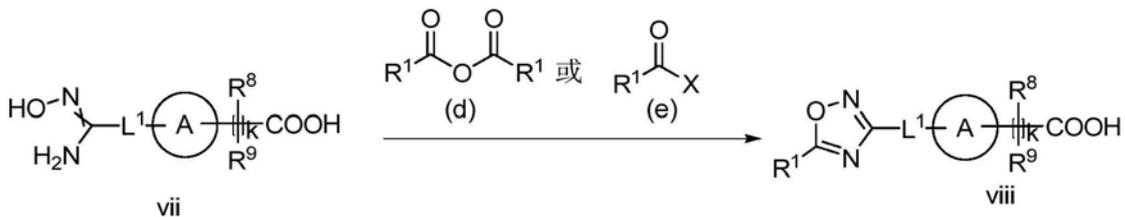
其中, L¹是直接键;且A是#;

b) 使式vi化合物与羟胺反应以得到式vii化合物;



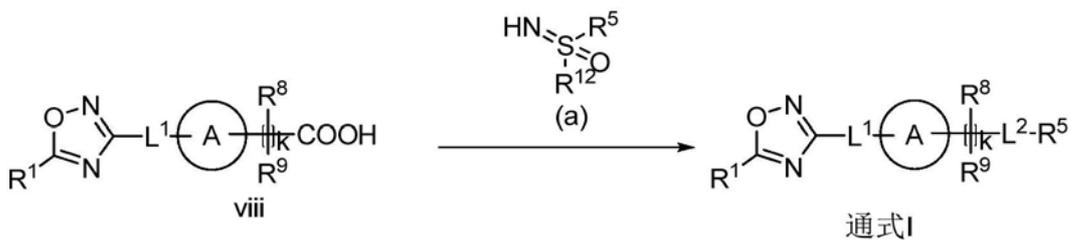
其中, L¹是直接键;且A是#;

c) 使式vii化合物与式(d)的酸酐或式(e)的酰氯化物反应以得到式viii化合物;



其中, L¹是直接键;A是# X = Br、Cl或I;

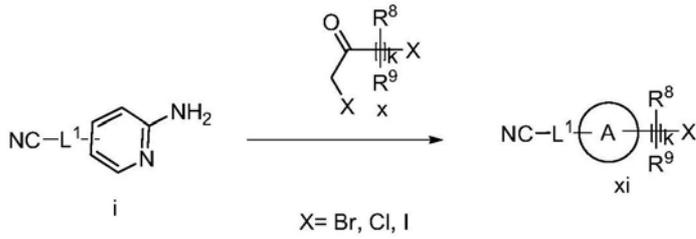
d) 使式viii化合物与式(a)的化合物反应得到通式(I)化合物;



其中, L¹是直接键;A是#;且L²是#。

15. 一种根据权利要求1所述的通式(I)的化合物的制备方法,其中,所述方法包括以下步骤:

a) 使式i的化合物与式x的化合物反应以得到式xi化合物;



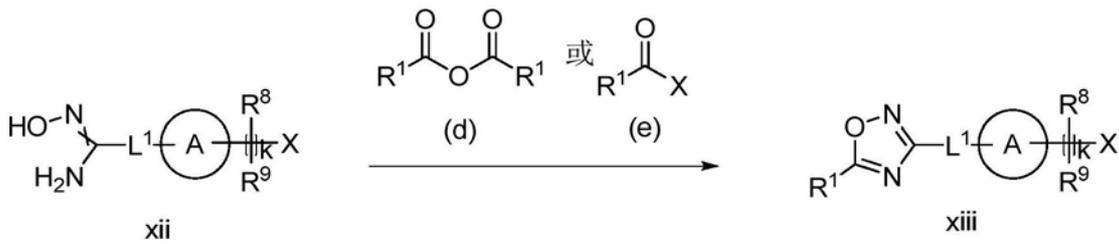
其中, L¹是直接键; A是# ;

b) 使式xi化合物与羟胺反应以得到式xii化合物;



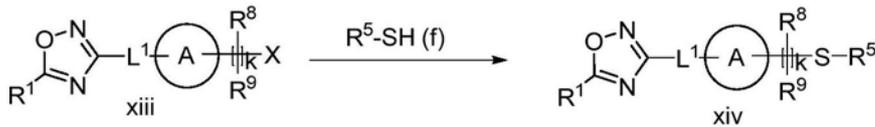
其中, L¹是直接键; A是# ; 且X是Cl、Br、I;

c) 使式xii化合物与式(d)的酸酐或式(e)的酰氯化合物反应以得到式xiii化合物;



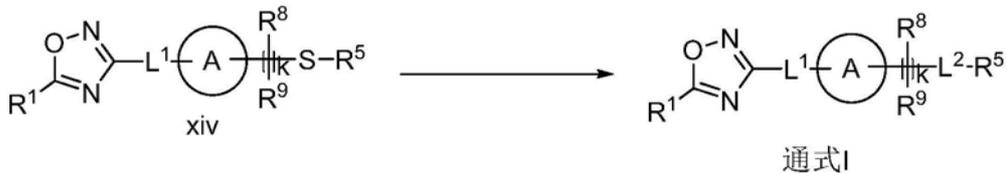
其中, L¹是直接键; X是Cl、Br、I; 且A是# ;

d) 使式xiii化合物与式(f)的化合物反应得到式xiv化合物;



其中, L¹是直接键; A是# ; X是Cl、Br、I;

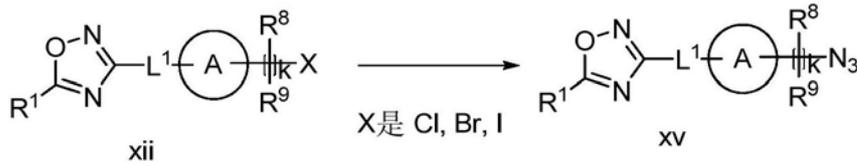
e) 将式xiv化合物用合适的氧化剂氧化, 得到通式(I)化合物;

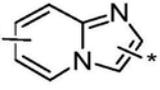


其中, L¹是直接键; A是# ; L²是-S(=O)₀₋₂。

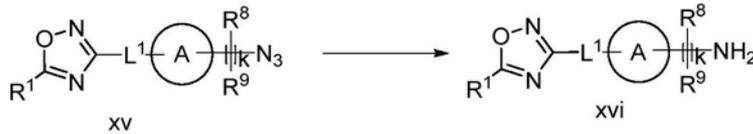
16. 一种根据权利要求1所述的通式(I)的化合物的制备方法, 其中, 所述方法包括以下步骤:

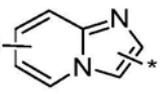
a) 使式xii化合物与合适的碱金属叠氮化物反应以得到式xv化合物；



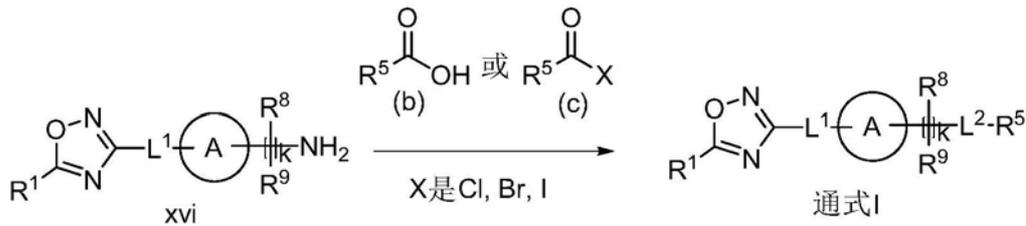
L¹是直接键；A是#；

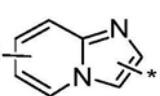
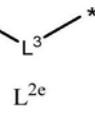
b) 使式xv化合物与合适的还原剂反应以得到式xvi化合物；



L¹是直接键；A是#；

c) 使式xvi化合物与式(b)的羧酸或式(c)的酰氯化合物反应以得到通式(I)的化合物；

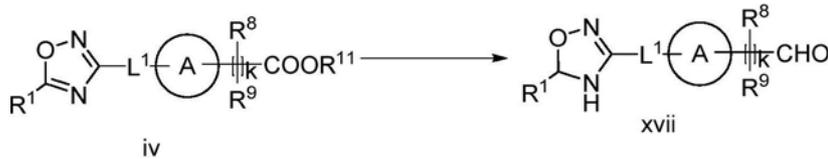


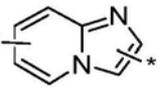
L¹为直接键；A是#；L²是#，其中，Y是-NR¹⁰，并且

L³是C(=O)-。

17. 一种根据权利要求1所述的通式(I)的化合物的制备方法，其中，所述方法包括以下步骤：

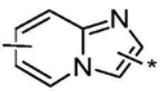
a) 使式iv化合物与合适的还原剂反应以得到式xvii化合物；



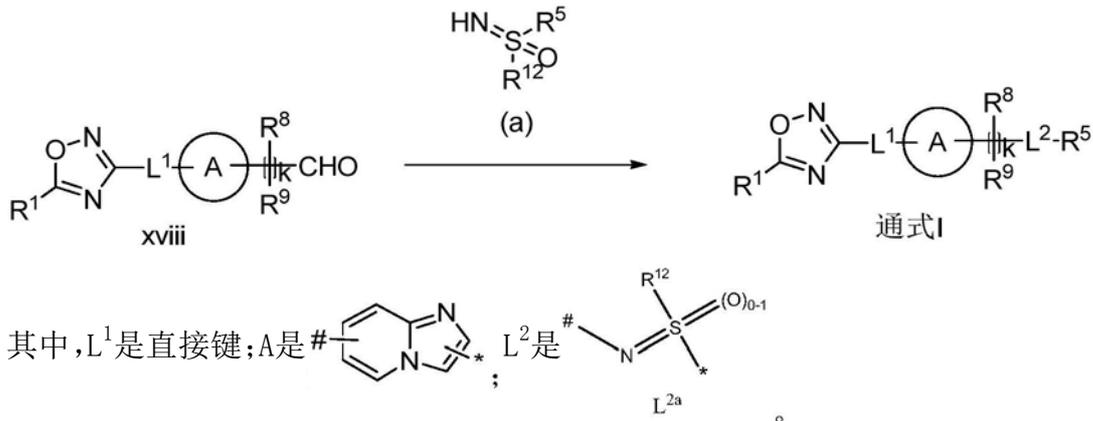
其中，L¹是直接键；A是#；

b) 使式xvii化合物与合适的氧化剂反应以得到式xviii化合物；

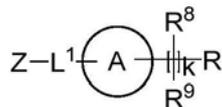


其中，L¹是直接键；A是#；

c) 使式xviii的化合物与式(a)的亚磺亚胺化合物反应以得到通式(I)的化合物;

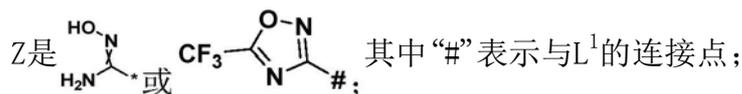


18. 一种通式(B)的化合物,



通式(B)

其中,



L^1 是直接键;

A 是 其中“#”和“*”表示连接点;

R^8 和 R^9 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基和 C_3 - C_8 -环烷基;

k 是 0 和 1 范围内的整数;

R 选自氢、叠氮基、卤素、羟基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -卤代烷氧基、 C_1 - C_6 -烷基硫基、 C_1 - C_6 -卤代烷基硫基、 C_3 - C_8 -环烷基、氨基- C_1 - C_6 -烷基、二- C_1 - C_6 -烷基氨基、 $NHSO_2$ - C_1 - C_6 -烷基、 $-S(=O)(=NH)-C_1$ - C_6 -烷基、 $-C(=O)-C_1$ - C_6 -烷基、 $C(=O)-C_1$ - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基、羟基- C_1 - C_6 -烷基、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $C(=O)-NH(C_1-C_6-烷基)$ 、 C_1 - C_6 -烷基硫基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基氨基- C_1 - C_6 -烷基、二- C_1 - C_6 -烷基氨基- C_1 - C_6 -烷基、氨基羰基- C_1 - C_6 -烷基和 C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_6 -烷基;

条件是以下化合物被排除在通式(I)化合物的定义之外;

(Z)-2-(6-(N' -羟基甲脒基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯, 6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸和 (Z)-2-(7-(N' -羟基甲脒基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯。

19. 根据权利要求18所述的通式(B)的化合物, 其中, 所述通式(B)的化合物选自7-(N' -羟基甲脒基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸、2-(7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯、7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸、7-(5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲

醛、7-(5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲醛、2-(氯甲基)-N'-羟基咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲脒、3-(2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑、3-(2-(叠氮甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑、2-(6-(5-(三氟甲基))-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯、6-(N'-羟基甲脒基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸、2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯、6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲醛、6-(5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲醛、3-(2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑、2-(氯甲基)-N'-羟基咪唑并[1,2-a]吡啶-6-甲脒、3-(2-(叠氮甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑和亚氨基(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砷。

用于控制或预防植物病原真菌的新型噁二唑化合物

技术领域

[0001] 本发明涉及用于防治植物病原真菌的新型噁二唑化合物、其组合以及包含该新型噁二唑化合物的组合物。本发明还涉及用于控制或预防植物病原真菌的方法。

背景技术

[0002] 噁二唑已在文献中被公开。例如，在JPS5665881、JPS63162680、JPS6296480、JPS6051188、W02005051932、EP3165093、EP3167716、EP3165093、W02017076740、W02017102006、W02017110861、W02017110862、W02017110864、W02017157962、W02017174158、W02017198852、W02017207757、W02017211650、W02017211652、W02017220485、W02017072247、W02017076742、W02017076757、W02017076935、W02018015447、W02018065414、W02018118781、W02018187553和W02018202491中已公开了各种噁二唑化合物。

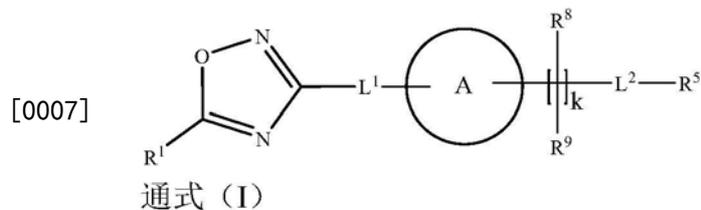
[0003] 上述文献中报道的噁二唑化合物在某些方面具有缺点，例如，它们表现出窄的施用谱，或者它们不具有令人满意的杀真菌活性，特别是在低施用率的情况下。

[0004] 因此，本发明的一个目的是提供对植物病原真菌具有改进/增强的活性和/或更宽的活性谱的化合物。

[0005] 该目的是通过使用本发明的用于控制或预防植物病原真菌的通式(I)化合物来实现。

发明内容

[0006] 本发明涉及通式(I)的化合物，



[0008] 其中， R^1 、 L^1 、 A 、 k 、 R^8 、 R^9 、 L^2 和 R^5 如具体实施方式中所定义。本发明还涉及一种用于制备通式(I)的化合物的方法。

[0009] 已发现通式(I)的化合物在提高的杀真菌效力、更广的生物活性谱、更低的施用率、更有利的生物或环境性质、或者增强的植物相容性的任一方面优于文献中报道的化合物。

[0010] 本发明进一步涉及包含本发明的通式(I)的化合物和至少一种其他的农药活性物质的组合，用于有效控制或预防难以防治的植物病原真菌。

[0011] 本发明还进一步涉及包含通式(I)的化合物或通式(I)的化合物与其他农药活性物质组合的组合物。

[0012] 本发明更进一步涉及通式(I)化合物、其组合或组合物用于控制和/或预防植物病

害,特别是植物病原真菌的方法和用途。

具体实施方式

[0013] 定义:

[0014] 在本文中提供的对在本公开中使用的术语的定义仅用于说明目的,决不限制在本公开中所公开的本发明的范围。

[0015] 如本文所用,术语“包含”、“包括”、“具有”、“含有”、“特征在于”或其任何其他变体意图覆盖非排他性包含,但受到明确指出的任何限制。例如,包含元素列表的组合物、混合物、工艺或方法不一定仅限于那些元素,而是可以包括未明确列出的或对于此类组合物、混合物、工艺或方法固有的其他元素。

[0016] 过渡短语“由……组成”不包括未指定的任何元素、步骤或成分。如果是在权利要求中,这将使权利要求除了通常与之相关的杂质以外,不包括除了其列举的材料之外的材料。当短语“由……组成”出现在权利要求正文的条款中时,而不是紧跟在序言之后,它仅限制了该条款中规定的元素;其他元素不被排除在作为整体的权利要求之外。

[0017] 过渡短语“基本上由……组成”用于定义除字面上公开的那些之外还包含材料、步骤、特征、组分或元素的组合物或方法,条件是这些额外的材料、步骤、特征、组分或元素不包括对要求保护的发明的基本和新颖特征产生实质性影响。术语“基本上由……组成”介于“包含”和“由……组成”之间。

[0018] 此外,除非另有明确说明,否则“或”指的是包含性的“或”,而不是排他性的“或”。例如,条件A“或”B满足以下任一条件:A为真(或存在)且B为假(或不存在),A为假(或不存在)且B为真(或存在),以及A和B都为真(或存在)。

[0019] 此外,在本发明的元素或组分之前的不定冠词“一”和“一个”(a, an)意图对元素或组分的实例(即出现)的数量没有限制。因此,“一”或“一个”应被理解为包括一个或至少一个,并且元素或组分的单数词形式也包括复数,除非该数字显然是单数。

[0020] 在本公开中所提及的术语“无脊椎动物害虫”包括作为害虫具有经济重要性的节肢动物、腹足动物和线虫。术语“节肢动物”包括昆虫、螨类、蜘蛛、蝎子、蜈蚣、千足虫、潮虫类(pill bugs)和综合纲(symphylans)。术语“腹足动物”包括蜗牛、蛞蝓和其他柄眼目(Stylommatophora)。术语“线虫”是指线虫门的活生物体。术语“蠕虫”包括蛔虫、心丝虫、植食性线虫(线虫纲(Nematoda))、吸虫((吸虫纲Trematoda))、棘头虫和绦虫((绦虫纲Cestoda))。

[0021] 在本公开的上下文中,“无脊椎动物害虫控制”是指抑制无脊椎动物害虫的发展(包括死亡率、摄食减少和/或交配干扰),并且相关表达也类似定义。

[0022] 术语“农艺”是指大田作物(例如用于食品、饲料和纤维的大田作物)的生产,包括以下作物的生长:玉米、大豆和其他豆类、水稻、禾谷类(例如小麦、燕麦、大麦、黑麦、水稻、玉蜀黍)的生长、叶类蔬菜(例如莴苣、甘蓝和其他芸苔属作物)、果类蔬菜(例如西红柿、椒类、茄子、十字花科植物和葫芦科植物)、马铃薯、甘薯、葡萄、棉花、树果(例如梨果、核果和柑橘)、小水果(浆果、樱桃)和其他特色作物(例如芥花、向日葵、橄榄)。

[0023] 术语“非农艺”是指大田作物以外,例如园艺作物(例如,不在大田间生长的温室、苗圃或观赏植物),住宅、农业、商业和工业建筑,草皮(例如草皮农场、牧场、高尔夫球场、草

坪、运动场等),木制品,储藏物,农林和植被管理,公共健康(即人类)和动物健康(例如,家养动物,如宠物、家畜和家禽,未驯化的动物,如作为野生动物)的应用。

[0024] 非农艺的应用包括通过将杀寄生虫有效(即生物学有效)量的本发明化合物(通常以配制用于兽医用途的组合物的形式)施用于要保护的动物来保护动物免受无脊椎动物寄生虫的侵害。如本公开和权利要求中所提及的,术语“杀寄生虫的”和“杀寄生虫地”是指对无脊椎寄生虫有可观察的效果,以提供对动物免受害虫侵害的保护。杀寄生虫的效果通常涉及减少目标无脊椎寄生虫的发生或活动。对害虫的此类效果包括坏死、死亡、生长迟缓、活动性减弱或在宿主动物上或体内停留的能力减弱、进食减少和繁殖受到抑制。这些对无脊椎动物寄生虫害虫的效果提供了对动物寄生虫侵害或感染的控制(包括预防、减少或消除)。

[0025] 本公开的化合物可以以纯形式或作为不同可能的异构形式(例如立体异构体或结构异构体)的混合物存在。各种立体异构体包括对映异构体、非对映异构体、手性异构体、阻转异构体、构象异构体、旋转异构体、互变异构体、光学异构体、多晶型物和几何异构体。这些异构体的任何期望的混合物都落入本公开的权利要求的范围内。本领域的技术人员将理解,当相对于其他异构体富集或与其他异构体分离时,一种立体异构体可能更具活性和/或可能表现出有益效果。此外,本领域技术人员知道分离、富集和/或选择性制备所述异构体的工艺或方法或技术。

[0026] 现在将说明在说明书中使用的各种术语的含义。

[0027] 单独使用或以复合词(如“烷基硫基”或“卤代烷基”或-N(烷基)或烷基羰基烷基或烷基磺酰基氨基)使用的术语“烷基”包括直链或支链的 C_1 至 C_{24} 烷基,优选 C_1 至 C_{15} 烷基,更优选 C_1 至 C_{10} 烷基,最优选 C_1 至 C_6 烷基。烷基的非限制性实例包括甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、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、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-甲基丙基或不同的异构体。如果烷基位于复合取代基的末端,例如在烷基环烷基中,复合取代基的起始部分,例如环烷基,可以相同或不同地且独立地被烷基单或多取代。这同样也适用于其中其他基团(例如烯基、炔基、羟基、卤素、羰基、羰基氧基等)位于末端的复合取代基。

[0028] 单独使用或在复合词中使用的术语“烯基”包括直链或支链的 C_2 至 C_{24} 烯烃,优选 C_2 至 C_{15} 烯烃,更优选 C_2 至 C_{10} 烯烃,最优选 C_2 至 C_6 烯烃。烯烃的非限制性实例包括乙烯基、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-丙烯基和1-乙基-2-甲基-2-丙烯基以及不同的异构体。“烯基”还包括多烯,例如1,2-丙二烯基和2,4-己二烯基。除非在别处具体定义,否则该定义也适用于作为复合取代基的一部分的烯基,例如卤代烯基等。

[0029] 炔烃的非限制性实例包括乙炔基、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-丁炔基和1-乙基-1-甲基-2-丙炔基以及不同的异构体。除非在别处具体定义,否则该定义也适用于作为复合取代基的一部分的炔基,例如卤代炔基等。术语“炔基”还可包括由多个三键组成的部分,例如2,5-己二炔基。

[0030] 术语“环烷基”是指闭合形成环的烷基。非限制性实例包括环丙基、环戊基和环己基。除非在别处具体定义,否则该定义也适用于作为复合取代基的一部分的环烷基,例如环烷基烷基等。

[0031] 术语“环烯基”是指闭合以形成包括部分不饱和烃基的单环的环的烯基。非限制性实例包括环丙烯基、环戊烯基和环己烯基。除非在别处具体定义,否则该定义也适用于作为复合取代基的一部分的环烯基,例如环烯基烷基等。

[0032] 术语“环炔基”是指闭合以形成包括部分不饱和基的单环的环的炔基。非限制性实例包括环丙炔基、环戊炔基和环己炔基。除非在别处具体定义,否则该定义也适用于作为复合取代基的一部分的环炔基,例如环炔基烷基等。

[0033] 术语“环烷氧基”、“环烯基氧基”等的定义类似。环烷氧基的非限制性实例包括环丙基氧基、环戊基氧基和环己基氧基。除非在别处具体定义,否则该定义也适用于作为复合取代基的一部分的环烷氧基,例如环烷氧基烷基等。

[0034] 单独使用或以复合词(如“卤代烷基”)使用的术语“卤素”包括氟、氯、溴或碘。此外,当用于复合词如“卤代烷基”时,所述烷基可以部分或全部被相同或不同的卤素原子取代。“卤代烷基”的非限制性实例包括氯甲基、溴甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、1-氯乙基、1-溴乙基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基、1,1-二氯-2,2,2-三氟乙基和1,1,1-三氟丙-2-基。除非在别处具体定义,否则该定义也适用于作为复合取代基的一部分的卤代烷基,例如卤代烷

基氨基烷基等。

[0035] 术语“卤代烯基”、“卤代炔基”的定义类似,不同之处在于,烯基和炔基代替烷基作为取代基的一部分存在。

[0036] 术语“卤代烷氧基”是指直链或支链烷氧基,其中这些基团中的一些或全部氢原子可以如上所述被卤素原子取代。卤代烷氧基的非限制性实例包括氯甲氧基、溴甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、1-氯乙氧基、1-溴乙氧基、1-氟乙氧基、2-氟乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、五氟乙氧基和1,1,1-三氟丙-2-氧基。除非在别处具体定义,否则该定义也适用于作为复合取代基的一部分的卤代烷氧基,例如卤代烷氧基烷基等。

[0037] 术语“卤代烷基硫基”是指直链或支链烷基硫基,其中这些基团中的一些或全部氢原子可以如上所述被卤素原子取代。卤代烷基硫基的非限制性实例包括氯甲基硫基、溴甲基硫基、二氯甲基硫基、三氯甲基硫基、氟甲基硫基、二氟甲基硫基、三氟甲基硫基、氯氟甲基硫基、二氯氟甲基硫基、氯二氟甲基硫基、1-氯乙基硫基、1-溴乙基硫基、1-氟乙基硫基、2-氟乙基硫基、2,2-二氟乙基硫基、2,2,2-三氟乙基硫基、2-氯-2-氟乙基硫基、2-氯-2,2-二氟乙基硫基、2,2-二氯-2-氟乙基硫基、2,2,2-三氯乙基硫基、五氟乙基硫基和1,1,1-三氟丙-2-基硫基。除非在别处具体定义,否则该定义也适用于作为复合取代基的一部分的卤代烷基硫基,例如卤代烷基硫基烷基等。

[0038] “卤代烷基亚磺酰基”的非限制性实例包括 $\text{CF}_3\text{S}(0)$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(0)$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(0)$ 和 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(0)$ 。“卤代烷基磺酰基”的非限制性实例包括 $\text{CF}_3\text{S}(0)_2$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(0)_2$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(0)_2$ 和 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(0)_2$ 。

[0039] 术语“羟基”是指-OH,氨基是指-NRR,其中R可以是H或任何可能的取代基,如烷基。羰基是指 $\text{-C}(=\text{O})-$,羧基氧基是指 $\text{-OC}(=\text{O})-$,亚磺酰基是指 SO ,磺酰基是指 $\text{S}(0)_2$ 。

[0040] 单独使用或在复合词中使用的术语“烷氧基”包括 C_1 至 C_{24} 烷氧基,优选 C_1 至 C_{15} 烷氧基,更优选 C_1 至 C_{10} 烷氧基,最优选 C_1 至 C_6 烷氧基。烷氧基的实例包括甲氧基、乙氧基、丙氧基、1-甲基乙氧基、丁氧基、1-甲基丙氧基、2-甲基丙氧基、1,1-二甲基乙氧基、戊氧基、1-甲基丁氧基、2-甲基丁氧基、3-甲基丁氧基、2,2-二甲基丙氧基、1-乙基丙氧基、己氧基、1,1-二甲基丙氧基、1,2-二甲基丙氧基、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-甲基丙氧基和1-乙基-2-甲基丙氧基以及不同的异构体。除非在别处具体定义,否则该定义也适用于作为复合取代基的一部分的烷氧基,例如卤代烷氧基,炔基烷氧基等。

[0041] 术语“烷氧基烷基”表示烷基上的烷氧基取代。“烷氧基烷基”的非限制性实例包括 CH_3OCH_2 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 。

[0042] 术语“烷氧基烷氧基”表示烷氧基上的烷氧基取代。

[0043] 术语“烷基硫基”包括支链或直链的烷基硫基部分,例如甲基硫基、乙基硫基、丙基硫基、1-甲基乙基硫基、丁基硫基、1-甲基丙基硫基、2-甲基丙基硫基、1,1-二甲基乙基硫基、戊基硫基、1-甲基丁基硫基、2-甲基丁基硫基、3-甲基丁基硫基、2,2-二甲基丙基硫基、

1-乙基丙基硫基、己基硫基、1,1-二甲基丙基硫基、1,2-二甲基丙基硫基、1-甲基戊基硫基、2-甲基戊基硫基、3-甲基戊基硫基、4-甲基戊基硫基、1,1-二甲基丁基硫基、1,2-二甲基丁基硫基、1,3-二甲基丁基硫基、2,2-二甲基丁基硫基、2,3-二甲基丁基硫基、3,3-二甲基丁基硫基、1-乙基丁基硫基、2-乙基丁基硫基、1,1,2-三甲基丙基硫基、1,2,2-三甲基丙基硫基、1-乙基-1-甲基丙基硫基和1-乙基-2-甲基丙基硫基以及不同的异构体。

[0044] 卤代环烷基、卤代环烯基、烷基环烷基、环烷基烷基、环烷基氧基烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基、卤代烷基羰基、环烷基羰基、卤代烷氧基烷基等的定义与上述实例类似。

[0045] 术语“烷基硫基烷基”表示烷基上的烷基硫基取代。“烷基硫基烷基”的非限制性实例包括 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 。“烷基硫基烷氧基”表示烷氧基上的烷基硫基取代。术语“环烷基烷基氨基”表示烷基氨基上的环烷基取代。

[0046] 术语“烷氧基烷氧基烷基”、“烷基氨基烷基”、“二烷基氨基烷基”、“环烷基氨基烷基”、“环烷基氨基羰基”等与“烷基硫基烷基”或“环烷基烷基氨基”类似地定义。

[0047] 术语“烷氧基羰基”是通过羰基($-\text{CO}-$)与骨架结合的烷氧基。除非在别处具体定义,否则该定义也适用于作为复合取代基的一部分的烷氧基羰基,例如环烷基烷氧基羰基等。

[0048] 术语“烷氧基羰基烷基氨基”表示烷基氨基上的烷氧基羰基取代。“烷基羰基烷基氨基”表示烷基氨基上的烷基羰基取代。术语烷基硫基烷氧基羰基、环烷基烷基氨基烷基等的定义类似。

[0049] “烷基亚磺酰基”的非限制性实例包括甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、丙基亚磺酰基、1-甲基乙基亚磺酰基、丁基亚磺酰基、1-甲基丙基亚磺酰基、2-甲基丙基亚磺酰基、1,1-二甲基乙基亚磺酰基、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、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、1,1-二甲基丙基亚磺酰基、1,2-二甲基丙基亚磺酰基、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-甲基丙基亚磺酰基和1-乙基-2-甲基丙基亚磺酰基以及不同的异构体。术语“芳基亚磺酰基”包括 $\text{Ar-S}(0)$,其中Ar可以是任何碳环或杂环。除非在别处具体定义,否则该定义也适用于作为复合取代基的一部分的烷基亚磺酰基,例如卤代烷基亚磺酰基等。

[0050] “烷基磺酰基”的非限制性实例包括甲基磺酰基、乙基磺酰基、丙基磺酰基、1-甲基乙基磺酰基、丁基磺酰基、1-甲基丙基磺酰基、2-甲基丙基磺酰基、1,1-二甲基乙基磺酰基、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、2,2-二甲基丙基磺酰基、1-乙基丙基磺酰基、己基磺酰基、1,1-二甲基丙基磺酰基、1,2-二甲基丙基磺酰基、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-甲基丙基磺酰基和1-乙

基-2-甲基丙基磺酰基以及不同的异构体。术语“芳基磺酰基”包括 Ar-S(O)_2 ，其中Ar可以是任何碳环或杂环。除非在别处定义，否则该定义也适用于作为复合取代基的一部分的烷基磺酰基，例如烷基磺酰基烷基等。

[0051] “烷基氨基”、“二烷基氨基”等的定义与上述实例类似。

[0052] 术语“碳环(carbocycle或carbocyclic)”包括“芳族碳环系统”和“非芳族碳环系统”或多环或双环(螺合、稠合、桥连、非稠合)的环化合物，其中环可以是芳族或非芳族的(其中芳族表示满足休克尔法则，非芳族表示不满足休克尔法则)。

[0053] 术语“杂环(heterocycle或heterocyclic)”包括“芳族杂环或杂芳环系统”和“非芳族杂环系统”或多环或双环(螺合、稠合、桥连、非稠合)的环化合物，其中环可以是芳族或非芳族的，其中杂环含有至少一个选自N、O、S(O)₀₋₂的杂原子，和/或杂环的C环成员可以被C(=O)、C(=S)、C(=CR^{*}R^{*})和C=NR^{*}替换，*表示整数。

[0054] 术语“非芳族杂环(non-aromatic heterocycle, non-aromatic heterocyclic)”是指含有一至四个选自氧、氮和硫的杂原子的三至十五元，优选三至十二元的饱和或部分不饱和的杂环：单、双或三环杂环，其除了碳环成员外，还含有一到三个氮原子和/或一个氧或硫原子或一或两个氧和/或硫原子；如果环含有一个以上的氧原子，则它们不直接相邻；非限制性实例有，氧杂环丁烷基、氧杂环丙烷基、氮杂环丙烷基、2-四氢咪喃基、3-四氢咪喃基、2-四氢噻吩基、3-四氢噻吩基、1-吡咯烷基、2-吡咯烷基、3-吡咯烷基、3-异噁唑烷基、4-异噁唑烷基、5-异噁唑烷基、3-异噻唑烷基、4-异噻唑烷基、5-异噻唑烷基、1-吡唑烷基、3-吡唑烷基、4-吡唑烷基、5-吡唑烷基、2-噁唑烷基、4-噁唑烷基、5-噁唑烷基、2-噻唑烷基、4-噻唑烷基、5-噻唑烷基、1-咪唑烷基、2-咪唑烷基、4-咪唑烷基、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-1-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、2,3-二氢咪喃-2-基、2,3-二氢咪喃-3-基、2,4-二氢咪喃-2-基、2,4-二氢咪喃-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、吡咯啉基、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、哌啶基、2-哌啶基、3-哌啶基、4-哌啶基、吡嗪基、吗啉基、硫代吗啉基、1,3-二噁烷-5-基、2-四氢吡喃基、4-四氢吡喃基、2-四氢噻吩基、3-六氢哒嗪基、4-六氢哒嗪基、2-六氢嘧啶基、4-六氢嘧啶基、5-六氢嘧啶基、2-哌嗪基、1,3,5-六氢三嗪-2-基、1,2,4-六氢三嗪-3-基、环丝氨酸、2,3,4,5-四氢[1H]氮杂环庚三烯-1-或-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、3,4,5,6-四氢[2H]氮杂环庚三烯-2-或-3-或-4-或-5-或-

6-或-7-基、2,3,4,7-四氢[1H]氮杂环庚三烯-1-或-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,3,6,7-四氢[1H]氮杂环庚三烯-1-或-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、六氢氮杂环庚三烯-1-或-2-或-3-或-4-基、四氢和六氢氧杂环庚三烯基,例如2,3,4,5-四氢[1H]氧杂环庚三烯-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,3,4,7-四氢[1H]氧杂环庚三烯-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,3,6,7-四氢[1H]氧杂环庚三烯-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、六氢氮杂环庚三烯-1-或-2-或-3-或-4-基、四氢和六氢-1,3-二氮杂环庚三烯基、四氢和六氢-1,4-二氮杂环庚三烯基、四氢和六氢-1,3-氧氮杂环庚三烯基、四氢和六氢-1,4-氧氮杂环庚三烯基、四氢和六氢-1,3-二氧杂环庚三烯基、四氢和六氢-1,4-二氧杂环庚三烯基。除非在别处具体定义,否则该定义也适用于作为复合取代基的一部分的杂环基,例如杂环烷基等。

[0055] 术语“杂芳基”或“芳族杂环”是指含有一至四个选自氧、氮和硫的杂原子的5或6元、完全不饱和的单环系统;如果环含有多于一个的氧原子,则它们不直接相邻;含有一至四个氮原子或一至三个氮原子和一个硫或氧原子的5元杂芳基;其中除碳原子外还可含有一至四个氮原子或一至三个氮原子和一个硫或氧原子作为环成员的5元杂芳基,非限制性实例咪唑基、噻吩基、吡咯基、异噁唑基、异噻唑基,吡唑基、噁唑基、噻唑基、咪唑基、1,2,4-噁二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,2,4-三唑基、1,3,4-噁二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,3,4-三唑基、四唑基;含有一至四个氮原子的氮键合的5元杂芳基,或含有一至三个氮原子的苯并稠合的氮键合的5元杂芳基:5元杂芳基除碳原子外还可含有一至四个氮原子或一至三个氮原子作为环成员,且其中,两个相邻的碳环成员或一个氮和一个相邻的碳环成员可以通过丁-1,3-二烯-1,4-二基桥连,其中,一个或两个碳原子可以被氮原子取代,其中,这些环通过氮环成员之一连接到骨架,非限制性实例1-吡咯基、1-吡唑基、1,2,4-三唑-1-基、1-咪唑基、1,2,3-三唑-1-基和1,3,4-三唑-1-基。

[0056] 6元杂芳基含有一至四个氮原子:6元杂芳基除碳原子外还可分别含有一至三个和一至四个氮原子作为环成员,非限制性实例2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、3-哒嗪基、4-哒嗪基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、5-嘧啶基、2-吡嗪基、1,3,5-三嗪-2-基、1,2,4-三嗪-3-基和1,2,4,5-四嗪-3-基;含有一至三个氮原子或一个氮原子和一个氧或硫原子的苯并稠合5元杂芳基:非限制性实例:吡啶-1-基、吡啶-2-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、吡啶-5-基、吡啶-6-基、吡啶-7-基、苯并咪唑-1-基、苯并咪唑-2-基、苯并咪唑-4-基、苯并咪唑-5-基、吡唑-1-基、吡唑-3-基、吡唑-4-基、吡唑-5-基、吡唑-6-基、吡唑-7-基、吡唑-2-基、1-苯并咪唑-2-基、1-苯并咪唑-3-基、1-苯并咪唑-4-基、1-苯并咪唑-5-基、1-苯并咪唑-6-基、1-苯并咪唑-7-基、1-苯并噻吩-2-基、1-苯并噻吩-3-基、1-苯并噻吩-4-基、1-苯并噻吩-5-基、1-苯并噻吩-6-基、1-苯并噻吩-7-基、1,3-苯并噻唑-2-基、1,3-苯并噻唑-4-基、1,3-苯并噻唑-5-基、1,3-苯并噻唑-6-基、1,3-苯并噻唑-7-基、1,3-苯并噁唑-2-基、1,3-苯并噁唑-4-基、1,3-苯并噁唑-5-基、1,3-苯并噁唑-6-基和1,3-苯并噁唑-7-基;含有一至三个氮原子的苯并稠合六元杂芳基:非限制性实例喹啉-2-基、喹啉-3-基、喹啉-4-基、喹啉-5-基、喹啉-6-基、喹啉-7-基、喹啉-8-基、异喹啉-1-基、异喹啉-3-基、异喹啉-4-基、异喹啉-5-基、异喹啉-6-基、异喹啉-7-基和异喹啉-8-基。

[0057] 术语“三烷基甲硅烷基”包括连接至硅原子的3个支链和/或直链烷基并通过硅原子连接,例如三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基和叔丁基-二甲基甲硅烷基。“卤代三烷基甲

硅烷基”表示三个烷基中的至少一个被可以相同或不同的卤素原子而部分地或全部地取代。术语“烷氧基三烷基甲硅烷基”表示三个烷基中的至少一个被一个或多个可以相同或不同的烷氧基取代。术语“三烷基甲硅烷氧基”表示通过氧连接的三烷基甲硅烷基部分。

[0058] “烷基羰基”的非限制性实例包括 $C(=O)CH_3$ 、 $C(=O)CH_2CH_2CH_3$ 和 $C(=O)CH(CH_3)_2$ 。“烷氧基羰基”的非限制性实例包括 $CH_3OC(=O)$ 、 $CH_3CH_2OC(=O)$ 、 $CH_3CH_2CH_2OC(=O)$ 、 $(CH_3)_2CHOC(=O)$ 和不同的丁氧基-或戊氧基羰基异构体。“烷基氨基羰基”的非限制性实例包括 $CH_3NHC(=O)$ 、 $CH_3CH_2NHC(=O)$ 、 $CH_3CH_2CH_2NHC(=O)$ 、 $(CH_3)_2CHNHC(=O)$ 和不同的丁基氨基-或戊基氨基羰基异构体。“二烷基氨基羰基”的非限制性实例包括 $(CH_3)_2NC(=O)$ 、 $(CH_3CH_2)_2NC(=O)$ 、 $CH_3CH_2(CH_3)NC(=O)$ 、 $CH_3CH_2CH_2(CH_3)NC(=O)$ 和 $(CH_3)_2CHN(CH_3)C(=O)$ 。“烷氧基烷基羰基”的非限制性实例包括 $CH_3OCH_2C(=O)$ 、 $CH_3OCH_2CH_2C(=O)$ 、 $CH_3CH_2OCH_2C(=O)$ 、 $CH_3CH_2CH_2OCH_2C(=O)$ 和 $CH_3CH_2OCH_2CH_2C(=O)$ 。“烷硫基烷基羰基”的非限制性实例包括 $CH_3SCH_2C(=O)$ 、 $CH_3SCH_2CH_2C(=O)$ 、 $CH_3CH_2SCH_2C(=O)$ 、 $CH_3CH_2CH_2SCH_2C(=O)$ 和 $CH_3CH_2SCH_2CH_2C(=O)$ 。术语卤代烷基磺酰基氨基羰基、烷基磺酰基氨基羰基、烷基硫基烷氧基羰基、烷氧基羰基烷基氨基等定义类似。

[0059] “烷基氨基烷基羰基”的非限制性实例包括 $CH_3NHCH_2C(=O)$ 、 $CH_3NHCH_2CH_2C(=O)$ 、 $CH_3CH_2NHCH_2C(=O)$ 、 $CH_3CH_2CH_2CH_2NHCH_2C(=O)$ 和 $CH_3CH_2NHCH_2CH_2C(=O)$ 。

[0060] 术语“酰胺”是指 $A-R'C=ONR''-B$ ，其中 R' 和 R'' 表示取代基，且 A 和 B 表示任何基团。

[0061] 术语“硫代酰胺”是指 $A-R'C=SNR''-B$ ，其中 R' 和 R'' 表示取代基，且 A 和 B 表示任何基团。

[0062] 取代基中的碳原子的总数由前缀“ C_i-C_j ”表示，其中 i 和 j 是1至21的数字。例如， C_1-C_3 烷基磺酰基表示甲基磺酰基到丙基磺酰基； C_2 烷氧基烷基表示 CH_3OCH_2 ； C_3 烷氧基烷基表示，例如 $CH_3CH(OCH_3)$ 、 $CH_3OCH_2CH_2$ 或 $CH_3CH_2OCH_2$ ；且 C_4 烷氧基烷基表示包含总共四个碳原子被烷氧基取代的烷基的各种异构体，其实例包括 $CH_3CH_2CH_2OCH_2$ 和 $CH_3CH_2OCH_2CH_2$ 。在以上叙述中，当式I化合物包含一个或多个杂环时，所有取代基通过任何可用的碳或氮通过取代所述碳或氮上的氢而连接到这些环上。

[0063] 当化合物被带有下标的取代基取代时，下标表明所述取代基的数目可以超过1，所述取代基(当它们超过1时)独立地选自定义的取代基的组。此外，当 $(R)_m$ 中的下标 m 表示范围从例如0至4的整数时，则取代基的数目可选自0至4之间的整数，包括0和4。

[0064] 当一个基团包含一个可以是氢的取代基时，且当该取代基取氢时，则认为该基团是未被取代的。

[0065] 参考说明书中的非限制性实施方式来解释本文中的实施方式及其各种特征和有利细节。省略对众所周知的组分和工艺技术的描述，以免不必要地模糊本文中的实施方式。本文使用的实施例仅意图促进对可实践本文的实施方式的方式的理解并进一步使本领域技术人员能够实践本文的实施方式。因此，这些实施例不应被解释为限制本文的实施方式的范围。

[0066] 具体实施方式的描述将如此充分地揭示本文中的实施方式的一般性质，从而使其他人可以通过应用当前知识，在不脱离一般概念的情况下容易地为各种应用修改和/或适应这些具体实施方式，并且因此，这些改编和修改应该并且意图被理解为在所公开的实施方式的等同物的含义和范围内。应当理解，本文中所用的措辞或术语是为了描述而非限制

的目的。因此,虽然已经根据优选实施方式描述了本文的实施方式,但是本领域技术人员将认识到,可以在本文中描述的实施方式的精神和范围内进行修改来实践本文的实施方式。

[0067] 对本说明书中包括的文件、行为、材料、装置、文章等的任何讨论仅用于为本公开提供语境的目的。不应被视为承认任何或所有这些事项构成现有技术基础的一部分或者是与本公开相关的领域中的公知常识,因为它在本申请的优先权日期之前存在于任何地方。

[0068] 说明书和说明书/权利要求书中提及的数值虽然可能构成本发明的关键部分,但如果偏离这些数值的科学原理与在本发明公开的本发明的科学原理相同,则任何这些偏离仍应落入本发明的范围。

[0069] 如果合适,本发明的发明化合物可以以不同可能的异构形式的混合物存在,尤其是立体异构体,例如E和Z、苏式和赤式,以及光学异构体,但如果合适的话还有互变异构体。E和Z异构体,以及苏式和赤式异构体,以及光学异构体,这些异构体和可能的互变异构形式的任何所需混合物都被公开并要求保护。

[0070] 用于本公开目的的术语“害虫”包括但不限于真菌、原生藻菌(卵菌)、细菌、线虫、螨、蜱、昆虫和啮齿动物。

[0071] 术语“植物”在本文被理解为指所有植物和植物种群,例如期望和不期望的野生植物或农作物植物(包括天然存在的农作物植物)。农作物植物可以是可以通过常规育种和优化方法或通过生物技术和基因工程方法或这些方法的组合获得的植物,包括转基因植物和包括受植物育种者权利保护和不受保护的植物栽培品种。

[0072] 出于本公开的目的,术语“植物”包括以树木、灌木、草本植物、禾本植物、蕨类植物和苔藓为例的种类的活的生物体,它们通常生长在一个地点,通过其根部吸收水分和所需物质,并且通过光合作用在其叶子中合成养分。

[0073] 用于本发明目的的“植物”的例子包括但不限于农作物,例如小麦、黑麦、大麦、黑小麦、燕麦或稻;甜菜,例如糖用甜菜或饲用甜菜;水果和果树,例如梨果、核果或软果,例如苹果、梨、李、桃、扁桃、樱桃、草莓、树莓、黑莓或醋栗(gooseberries);豆科植物,如扁豆、豌豆、苜蓿或大豆;油料植物,例如油菜(rape)、芥菜(mustard)、橄榄、向日葵、椰子、可可豆、蓖麻油植物、油棕、花生或大豆;葫芦科植物,如南瓜、黄瓜或瓜(melons);纤维植物,如棉花、亚麻、大麻或黄麻;柑橘类水果和柑橘树,如橙、柠檬、葡萄柚或橘(mandarins);任何园艺植物、蔬菜,如菠菜、莴苣(lettuce)、芦笋(asparagus)、甘蓝(cabbages)、胡萝卜、洋葱、西红柿、土豆、葫芦(cucurbits)或红辣椒;月桂科植物,如鳄梨(avocados)、肉桂或樟脑;葫芦科;含油植物;能源和原材料植物,如禾谷类(cereals)、玉米、大豆、其他豆科植物、油菜、甘蔗或油棕;烟草;坚果;咖啡;茶;可可;香蕉;椒类(peppers);葡萄藤(鲜食葡萄和葡萄汁葡萄藤);蛇麻子(hop);草皮;甜叶(也称为甜叶菊);天然橡胶植物或观赏和林业植物,例如花卉、灌木、阔叶树或常绿植物,例如针叶树;以及植物繁殖材料,例如种子,以及这些植物的农作物材料。

[0074] 优选地,用于本发明目的的植物包括但不限于禾谷类、玉米、水稻、大豆和其他豆科植物、水果和果树、葡萄、坚果和坚果树、柑橘和柑橘树、任何园艺植物、葫芦科、产油植物、烟草、咖啡、茶、可可、糖用甜菜、甘蔗、棉花、马铃薯、番茄、洋葱、椒类和蔬菜、观赏植物、任何花卉植物和其他供人类和动物使用的植物。

[0075] 术语“植物部分”应理解为表示地上和地下的植物的所有部分和器官。出于本公开

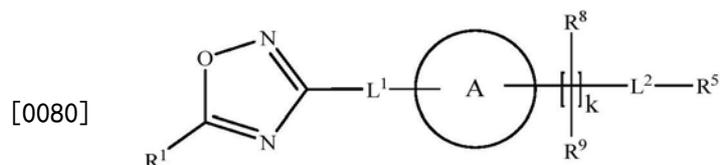
的目的,术语植物部分包括但不限于插条(cuttings)、叶子、芽枝(twigs)、块茎、花、种子、分枝(branches)、根(包括主根、侧根、根毛、根尖、根冠)、根状茎、幼枝(slips)、茎芽(shoots)、果实、子实体、树皮、主干(stem)、芽(buds)、腋芽(auxillary buds)、分生组织、结节(nodes)和节间(internodes)。

[0076] 术语“其场所”包括土壤、植物或植物部分的周围环境以及在播种/种植植物或植物部分之前、期间或之后使用的设备或工具。

[0077] 本公开的化合物或任选包含其他相容化合物的组合物中的本公开的化合物向植物或植物材料或其场所的施用包括通过本领域技术人员已知的技术施用,包括但不限于不限于喷涂、涂布、浸渍(dipping)、熏蒸、浸渍(impregnating)、注射和喷粉。

[0078] 术语“施用”是指以物理或化学方式粘附到植物或植物部分上,包括浸渍。

[0079] 有鉴于此,本发明提供一种通式(I)的化合物,



通式(I)

[0081] 其中,

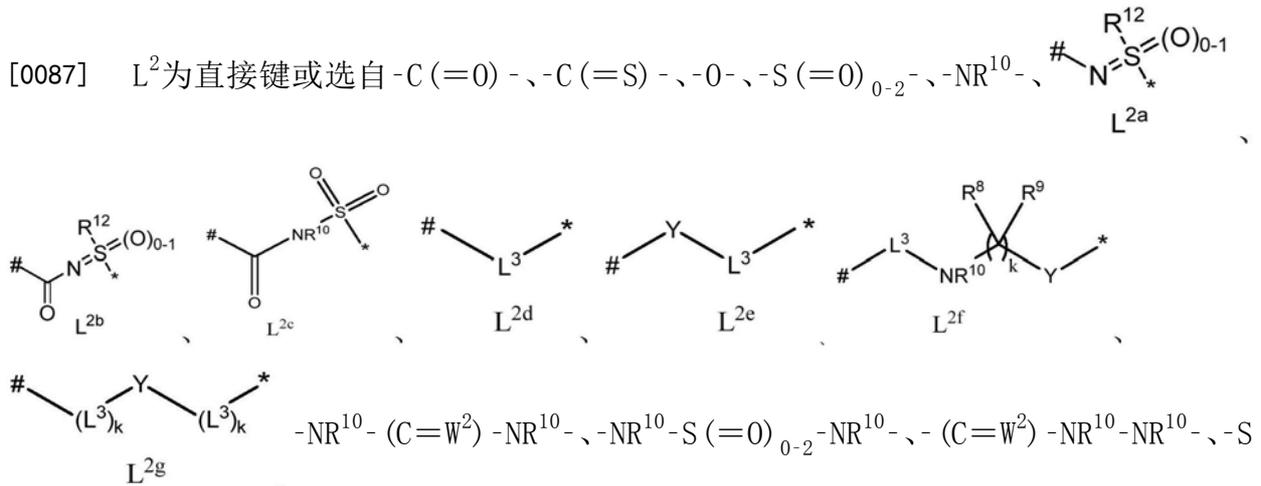
[0082] R^1 是 C_1 - C_2 -卤代烷基;

[0083] L^1 是直接键、 $-CR^2R^3-$ 、 $-C(=W^1)-$ 、 $-CR^2R^3C(=W^1)-$ 、 $-O-$ 、 $-S(=O)_{0-2}-$ 或 $-NR^{4a}-$;其中,基团开头和结尾的符号“-”表示与噁二唑环或A的连接点;

[0084] W^1 是O或S;

[0085] A是在一个或多个桥头处具有N的稠合杂双环;其中所述环任选地被一个或多个相同或不同的 R^A 基团取代;

[0086] R^A 选自氢、卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、 SF_5 、 C_1 - C_6 -烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_3 - C_8 -环烷基、 C_3 - C_8 -环烷基烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_6 -羟基烷基、 C_2 - C_6 -卤代烯基、 C_1 - C_6 -卤代炔基、 C_3 - C_8 -卤代环烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -卤代烷氧基、 C_1 - C_6 -卤代烷氧基羰基、 C_1 - C_6 -烷基硫基、 C_1 - C_6 -卤代烷基硫基、 C_1 - C_6 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 -卤代烷基磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基氨基、 C_1 - C_6 -二烷基氨基、 C_3 - C_8 -环烷基氨基、 C_1 - C_6 -烷基- C_3 - C_8 -环烷基氨基、 C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基、 C_1 - C_6 -烷基氨基羰基、 C_1 - C_6 -二烷基氨基羰基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基氧基、 C_1 - C_6 -烷基氨基羰基氧基或 C_1 - C_6 -二烷基氨基羰基氧基、以及3-至6-元碳环或杂环,其中,所述3-至6-元碳环或杂环可以任选地被一个或多个相同或不同的取代基取代,所述取代基选自卤素、氰基、硝基、羟基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_3 - C_8 -环烷基、 C_3 - C_8 -环烷基烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基烷基、 C_1 - C_6 -羟基烷基、 C_2 - C_6 -卤代烯基、 C_2 - C_6 -卤代炔基、 C_3 - C_6 -卤代环烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -烷基硫基、 C_1 - C_6 -卤代烷基硫基、 C_1 - C_6 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 -卤代烷基磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基氨基、二- C_1 - C_6 -烷基氨基、 C_3 - C_6 -环烷基氨基、 C_1 - C_6 -烷基- C_3 - C_6 -环烷基氨基、 C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基、 C_1 - C_6 -烷基氨基羰基、二- C_1 - C_6 -烷基氨基羰基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基氧基、 C_1 - C_6 -烷基氨基羰基氧基和二- C_1 - C_6 -烷基氨基羰基氧基;



[0088] Y是直接键或 $-NR^{10}-$ 、或 $-O-$ 、或 $-S(O)_{0-2}-$ 、或 $-C(=NOR^{11})-$ ；
 [0089] k为0至4的整数；符号“-”、“#”和“*”表示连接点；
 [0090] W^2 是O或S；

[0091] L^3 为直接键或选自 $-CR^{8a}R^{9a}-$ 、 $-CR^{8a}R^{9a}C(=O)-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-O-$ 、 $-S(=O)_{0-2}-$ 、 $-S(O)_{0-1}(=NR^{10})-$ 、 $-S(=N-CN)-$ 、 $-S(=N-NO_2)-$ 、 $-S(=N-COR^{8a})-$ 、 $-S(=N-COOR^{11})-$ 、 $-S(=N-S(=O)_2R^{12})-$ 、 $-NR^{10}-$ 、 $-NR^{10}C(=O)O-$ 、以及 $-CR^{8a}(=N)O-$ ；

[0092] R^{10} 选自氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_3-C_6 -环烯基、 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_6 -烷基、苯基- C_1-C_6 -烷基、苯基、吡啶基、 $C(=O)-(C_1-C_6$ -烷基)、 $C(=O)-(C_1-C_6$ -烷氧基)和 $-N(R^{10a})_2$ ；其中， R^{10a} 选自氢、羟基、 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_3-C_6 -环烯基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基和 C_1-C_6 -烷基硫基；每个 R^{10} 基团任选地被选自卤素、羟基、氧代、氰基、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基和 C_3-C_6 -环烷基的相同或不同基团取代；

[0093] R^{11} 选自氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_8 -环烷基、 C_1-C_6 -烷基硫基、 C_3-C_8 -环烯基、苯基- C_1-C_6 -烷基、杂芳基- C_1-C_6 -烷基、苯基和萘基；

[0094] R^{12} 选自氢， NR^gR^h ；其中， R^g 和 R^h 独立地选自氢、羟基、氰基、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基和 C_3-C_8 -环烷基； $C(=O)-R^i$ ，其中， R^i 选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_2-C_4 -炔基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_2-C_4 -卤代烯基、 C_2-C_4 -卤代炔基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_3-C_6 -环烯基、 C_1-C_4 -烷氧基和 C_1-C_4 -卤代烷氧基； C_{1-8} -烷基- $S(O)_{0-2}R^j$ ，其中 R^j 选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、 C_3-C_8 -环烷基； C_1-C_6 -烷基- $C(=O)-R^i$ ， $CR^i=NR^g$ ， C_1-C_6 -烷基， C_2-C_6 -烯基， C_2-C_6 -炔基， C_1-C_6 -卤代烷基， C_2-C_6 -卤代烯基， 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_3-C_8 -环烷基， C_4-C_8 -环烯基， C_7-C_{19} -芳烷基，双环 C_5-C_{12} -烷基， C_7-C_{12} -烯基和稠合或非稠合或双环 C_3-C_{18} -碳环或环系统；其中碳环或环系统的一个或多个C原子可以被 N 、 O 、 $S(=O)_{0-2}$ 、 $S(=O)_{0-1}$ 、 $(=NR^{10})$ 、 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $C(=CR^8R^9)$ 和 $C=NR^{10}$ 代替；

[0095] R^{12} 可以任选地被一个或多个相同或不同的取代基取代,所述取代基选自氢、卤素、氰基、硝基、羟基、 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_8 -环烷基、 C_3-C_8 -环烷基烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_6 -羟基烷基、 C_2-C_6 -卤代烯基、 C_2-C_6 -卤代炔基、 C_3-C_8 -卤代环烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基羰基、 C_1-C_6 -烷基硫基、 C_1-C_6 -卤代烷基硫基、 C_1-C_6 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 -卤代烷基磺酰基、 C_1-C_6 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 -烷基磺酰基、 C_1-C_6 -烷基氨基、二- C_1-C_6 -烷基氨基、 C_3-C_8 -环烷基氨基、 C_1-C_6 -烷基- C_3-C_8 -环烷基氨基、 C_1-C_6 -烷基羰基、 C_1-C_6 -烷氧基羰基、 C_1-C_6 -烷基氨基羰基、二- C_1-C_6 -烷基氨基羰基、 C_1-C_6 -烷氧基羰基氧基、 C_1-C_6 -烷基氨基羰基氧基、二- C_1-C_6 -烷基氨基羰基氧基、5-至11-元螺环和3-至6-元碳环或杂环;

[0096] R^8 和 R^9 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_8 -环烷基、 C_1-C_6 -烷基硫基、 C_3-C_8 -环烯基、苯基- C_1-C_6 -烷基、杂芳基- C_1-C_6 -烷基、苯基、萘基和3-至10-元饱和、部分不饱和或芳族单-或双环碳环或杂环,其中,杂芳基- C_1-C_6 -烷基的杂芳基和杂环的环成员包括C、N、O和S(O)₀₋₂,并且碳环或杂环的C环成员可以被一个或多个C(=O)和C(=S)替代;其中, R^8 和 R^9 独立地被一个或多个相同或不同的 R^{8a} 或 R^{9a} 取代;其中 R^{8a} 和 R^{9a} 选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基(sulfanyl)、氨基、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、 C_1-C_6 -烷基硫基、 C_1-C_6 -卤代烷基硫基、 C_3-C_8 -环烷基、氨基- C_1-C_6 -烷基、二- C_1-C_6 -烷基氨基、 $NHSO_2-C_1-C_6$ -烷基、 $-C(=O)-C_1-C_6$ -烷基、 $C(=O)-C_1-C_6$ -烷氧基、 C_1-C_6 -烷基磺酰基、羟基- C_1-C_6 -烷基、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $C(=O)-NH(C_1-C_6-烷基)$ 、 C_1-C_6 -烷基硫基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷基氨基- C_1-C_6 -烷基、二- C_1-C_6 -烷基氨基- C_1-C_6 -烷基、氨基羰基- C_1-C_6 -烷基和 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基;或者

[0097] R^8 和 R^9 与它们所键合的原子一起形成C(=O)或乙烯基或饱和的单环3-至7-元杂环或碳环,其中,杂环的环成员包括C、N、O和S(O)₀₋₂;并且其中乙烯基、杂环或碳环未被取代或被一个或多个相同或不同的 R^{8b} 取代,其中 R^{8b} 选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、 C_1-C_6 -烷基硫基、 C_1-C_6 -卤代烷基硫基、 C_3-C_8 -环烷基、 $SO_2-C_1-C_6$ -烷基、 $NHSO_2-C_1-C_6$ -烷基、 $-C(=O)-C_1-C_6$ -烷基、 $C(=O)-C_1-C_6$ -烷氧基、 C_1-C_6 -烷基磺酰基、 $SO_2-C_6H_4CH_3$ 和 SO_2 -芳基;

[0098] R^5 选自下组:氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_2-C_6 -卤代烯基、 C_2-C_6 -卤代炔基、 C_3-C_8 -环烷基、 C_3-C_8 -卤代环烷基、 C_1-C_6 -烷基- C_3-C_8 -环烷基、 C_3-C_8 -环烷基- C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_8 -环烷基- C_3-C_8 -环烷基、 C_3-C_8 -卤代环烷基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷基- C_3-C_8 -环烷基- C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_8 -环烯基、 C_3-C_8 -卤代环烯基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_8 -环烷氧基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷基- C_1-C_6 -硫基烷基、 C_1-C_6 -烷基亚磺酰基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷基磺酰基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷基氨基、二- C_1-C_6 -烷基氨基、 C_1-C_6 -烷基氨基- C_1-C_6 -烷基、二- C_1-C_6 -烷基氨基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基氨基- C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_8 -环烷基氨基、 C_3-C_8 -环烷基氨基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷基羰基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -羟基烷基、 C_2-C_6 -羟基烯基、 C_2-C_6 -羟基炔基、 C_3-C_8 -卤代环烷氧基、 C_3-C_8 -环烷基- C_1-C_6 -烷氧基、 C_2-C_6 -烯基氧基、 C_2-C_6 -卤代烯基氧基、 C_2-C_6 -炔基氧基、 C_2-C_6 -卤代炔基氧基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷基羰基烷氧基、 C_1-C_6 -烷基硫基、 C_1-C_6 -卤代烷基硫基、 C_3-C_8 -环烷基硫基、 C_1-C_6 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 -烷基磺酰基、 C_1-C_6 -卤代烷基磺酰基、 C_3-C_8 -环烷基磺酰基

基、C₃-C₈-环烷基亚磺酰基、三-C₁-C₆-烷基甲硅烷基、C₁-C₆-烷基磺酰基氨基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基氨基、C₁-C₆-烷基羰基硫基、C₁-C₆-烷基磺酰基氧基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基氧基、C₆-C₁₀-芳基磺酰基氧基、C₆-C₁₀-芳基亚磺酰基氧基、C₆-C₁₀-芳基磺酰基、C₆-C₁₀-芳基亚磺酰基、C₆-C₁₀-芳基硫基、C₁-C₆-氰基烷基、C₂-C₆-烯基羰基氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基硫基、C₁-C₆-烷基硫基-C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆-卤代烯基羰基氧基、C₁-C₆-烷氧基羰基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基-C₂-C₆-炔基、C₂-C₆-炔基硫基、C₃-C₈-卤代环烷基羰基氧基、C₂-C₆-烯基氨基、C₂-C₆-炔基氨基、C₁-C₆-卤代烷基氨基、C₃-C₈-环烷基-C₁-C₆-烷基氨基、C₁-C₆-烷氧基氨基、C₁-C₆-卤代烷氧基氨基、C₁-C₆-烷氧基羰基氨基、C₁-C₆-烷基羰基-C₁-C₆-烷基氨基、C₁-C₆-卤代烷基羰基-C₁-C₆-烷基氨基、C₁-C₆-烷氧基羰基-C₁-C₆-烷基氨基、C₂-C₆-烯基硫基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-卤代烷氧基羰基氨基、二-(C₁-C₆-卤代烷基)氨基-C₁-C₆-烷基、C₃-C₈-卤代环烯基氧基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基(C₁-C₆-烷基)氨基羰基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基氨基羰基、C₁-C₆-烷基磺酰基氨基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基烷氧基、C₁-C₆-烷基氨基硫基羰基氨基、C₃-C₈-环烷基-C₁-C₆-烷基氨基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷基硫基羰基、C₃-C₈-环烯基氧基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷氧基羰基、二-C₁-C₆-烷基氨基硫基羰基氨基、C₁-C₆-卤代烷氧基-C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-卤代烷氧基、C₃-C₈-卤代环烷氧基-C₁-C₆-烷基、二-C₁-C₆-烷基氨基羰基氨基、C₁-C₆-烷氧基-C₂-C₆-烯基、C₁-C₆-烷基硫基羰基氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基-C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-卤代烷基、二-(C₁-C₆-卤代烷基)氨基、二-C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷基氨基羰基氨基、C₁-C₆-卤代烷氧基-C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷基氨基羰基-C₁-C₆-烷基氨基、三-C₁-C₆-烷基甲硅烷基-C₂-C₆-炔基氧基、三-C₁-C₆-烷基甲硅烷基氧基、三-C₁-C₆-烷基甲硅烷基-C₂-C₆-炔基、氰基(C₁-C₆-烷氧基)-C₁-C₆-烷基、二-C₁-C₆-烷基硫基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基磺酰基、C₃-C₈-卤代环烷氧基羰基、C₁-C₆-烷基-C₃-C₈-环烷基羰基、C₃-C₈-卤代环烷基羰基、C₂-C₆-烯基氧基羰基、C₂-C₆-炔基氧基羰基、C₁-C₆-氰基烷氧基羰基、C₁-C₆-烷基硫基-C₁-C₆-烷氧基羰基、C₂-C₆-炔基羰基氧基、C₂-C₆-卤代炔基羰基氧基、氰基羰基氧基、C₁-C₆-氰基烷基羰基氧基、C₃-C₈-环烷基磺酰基氧基、C₃-C₈-环烷基-C₁-C₆-烷基磺酰基氧基、C₃-C₈-卤代环烷基磺酰基氧基、C₂-C₆-烯基磺酰基氧基、C₂-C₆-炔基磺酰基氧基、C₁-C₆-氰基烷基磺酰基氧基、C₂-C₆-卤代烯基磺酰基氧基、C₂-C₆-卤代炔基磺酰基氧基、C₂-C₆-炔基环烷氧基、C₂-C₆-氰基烯基氧基、C₂-C₆-氰基炔基氧基、C₁-C₆-烷氧基羰基氧基、C₂-C₆-烯基氧基羰基氧基、C₂-C₆-炔基氧基羰基氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基羰基氧基、硫亚胺、亚砷亚胺和SF₅或Z¹Q¹；R⁵可以任选地被一个或多个R⁶取代；

[0099] Z¹是直接键、CR^{2a}R^{3a}、N、O、C(O)、C(S)、C(=CR^{2a}R^{3a})或S(O)₀₋₂；

[0100] Q¹选自苯基、苄基、萘基、5-或6-元芳族环、8-至11-元芳族多环系统、8-至11-元芳族稠合环系统、5-或6-元杂芳族环、8-至11-元杂芳族多环系统和8-至11-元杂芳族稠合环系统；其中杂芳族环的杂原子选自N、O或S，并且每个环或环系统可以任选地被一个或多个独立地选自R¹³的取代基取代；或者

[0101] Q¹选自3-至7-元非芳族碳环、4-、5-、6-或7-元非芳族杂环、8-至15-元非芳族多环系统、5-至15-元螺环系统、8-至15-元非芳族稠合环系统，其中，非芳族环的杂原子选自N、O或S(O)₀₋₂，且非芳族碳环或非芳族杂环或环系统的C环成员可以用C(O)、C(S)、C(=CR^{2b}R^{3b})或C(=NR^{4b})代替，并且每个环或环系统可以任选地被一个或多个独立地选自R¹³的取代基

取代;

[0102] R^2 、 R^3 、 R^{2a} 、 R^{3a} 、 R^{2b} 和 R^{3b} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、 C_2 - C_4 -烯基、 C_2 - C_4 -炔基、 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_2 - C_4 -卤代烯基、 C_2 - C_4 -卤代炔基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_3 - C_6 -卤代环烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基和 C_1 - C_4 -卤代烷氧基;

[0103] R^2 和 R^3 ; R^{2a} 和 R^{3a} ; 和/或 R^{2b} 和 R^{3b} 与它们所连接的原子一起可以形成3-至5-元非芳族碳环或杂环,其可以任选地被卤素、 C_1 - C_2 -烷基、 C_1 - C_2 -卤代烷基或 C_1 - C_2 -烷氧基取代;

[0104] R^{4a} 和 R^{4b} 独立地选自氢、氰基、羟基、 NR^bR^c 、 $(C=O)-R^d$ 、 $S(O)_{0-2}R^e$ 、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -卤代烷氧基、 C_1 - C_6 -烷基氨基、二- C_1 - C_6 -烷基氨基、三- C_1 - C_6 -烷基氨基和 C_3 - C_8 -环烷基;

[0105] R^b 和 R^c 选自氢、羟基、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_3 - C_8 -环烷基和 C_3 - C_8 -卤代环烷基;

[0106] R^d 选自氢、羟基、卤素、 NR^bR^c 、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -卤代烷氧基、 C_3 - C_8 -环烷基和 C_3 - C_8 -卤代环烷基;

[0107] R^e 选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -卤代烷氧基和 C_3 - C_8 -环烷基和 C_3 - C_8 -卤代环烷基;

[0108] R^6 和 R^{13} 独立地选自氢、卤素、羟基、氰基、硝基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_2 - C_6 -卤代烯基、 C_2 - C_6 -卤代炔基、 C_3 - C_8 -环烷基、 C_3 - C_8 -卤代环烷基、 C_1 - C_6 -烷基- C_3 - C_8 -环烷基、 C_3 - C_8 -环烷基- C_1 - C_6 -烷基、 C_3 - C_8 -环烷基- C_3 - C_8 -环烷基、 C_3 - C_8 -卤代环烷基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基- C_3 - C_8 -环烷基- C_1 - C_6 -烷基、 C_3 - C_8 -环烯基、 C_3 - C_8 -卤代环烯基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_6 -烷基、 C_3 - C_8 -环烷氧基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基- C_1 - C_6 -硫基烷基、 C_1 - C_6 -烷基亚磺酰基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基氨基、二- C_1 - C_6 -烷基氨基、 C_1 - C_6 -烷基氨基- C_1 - C_6 -烷基、二- C_1 - C_6 -烷基氨基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基氨基- C_1 - C_6 -烷基、 C_3 - C_8 -环烷基氨基、 C_3 - C_8 -环烷基氨基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -卤代烷氧基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -羟基烷基、 C_2 - C_6 -羟基烯基、 C_2 - C_6 -羟基炔基、 C_3 - C_8 -卤代环烷氧基、 C_3 - C_8 -环烷基- C_1 - C_6 -烷氧基、 C_2 - C_6 -烯基氧基、 C_2 - C_6 -卤代烯基氧基、 C_2 - C_6 -炔基氧基、 C_2 - C_6 -卤代炔基氧基、 C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -烷基羰基烷氧基、 C_1 - C_6 -烷基硫基、 C_1 - C_6 -卤代烷基硫基、 C_3 - C_8 -环烷基硫基、 C_1 - C_6 -烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基、 C_1 - C_6 -卤代烷基磺酰基、 C_3 - C_8 -环烷基磺酰基、 C_3 - C_8 -环烷基亚磺酰基、三- C_1 - C_6 -烷基甲硅烷基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基氨基、 C_1 - C_6 -卤代烷基磺酰基氨基、 C_1 - C_6 -烷基羰基硫基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基氧基、 C_1 - C_6 -烷基亚磺酰基氧基、 C_6 - C_{10} -芳基磺酰基氧基、 C_6 - C_{10} -芳基亚磺酰基氧基、 C_6 - C_{10} -芳基磺酰基、 C_6 - C_{10} -芳基亚磺酰基、 C_6 - C_{10} -芳基硫基、 C_1 - C_6 -氰基烷基、 C_2 - C_6 -烯基羰基氧基、 C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_6 -烷基硫基、 C_1 - C_6 -烷基硫基- C_1 - C_6 -烷氧基、 C_2 - C_6 -卤代烯基羰基氧基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基- C_2 - C_6 -炔基、 C_2 - C_6 -炔基硫基、 C_3 - C_8 -卤代环烷基羰基氧基、 C_2 - C_6 -烯基氨基、 C_2 - C_6 -炔基氨基、 C_1 - C_6 -卤代烷基氨基、 C_3 - C_8 -环烷基- C_1 - C_6 -烷基氨基、 C_1 - C_6 -烷氧基氨基、 C_1 - C_6 -卤代烷氧基氨基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基氨基、 C_1 - C_6 -烷基羰基- C_1 - C_6 -烷基氨基、 C_1 - C_6 -卤代烷基羰基- C_1 - C_6 -烷基氨基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基- C_1 - C_6 -烷基氨基、 C_2 - C_6 -烯基硫基、 C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -卤代烷氧基羰基氨基、二- $(C_1$ - C_6 -卤代烷基)氨基- C_1 - C_6 -烷基、 C_3 - C_8 -卤代环烯基氧基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基(C_1 -

C₆-烷基)氨基羰基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基氨基羰基、C₁-C₆-烷基磺酰基氨基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基烷氧基、C₁-C₆-烷基氨基硫基羰基氨基、C₃-C₈-环烷基-C₁-C₆-烷基氨基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷基硫基羰基、C₃-C₈-环烯基氧基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷氧基羰基、二-C₁-C₆-烷基氨基硫基羰基氨基、C₁-C₆-卤代烷氧基-C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-卤代烷氧基、C₃-C₈-卤代环烷氧基-C₁-C₆-烷基、二-C₁-C₆-烷基氨基羰基氨基、C₁-C₆-烷氧基-C₂-C₆-烯基、C₁-C₆-烷基硫基羰基氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基-C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-卤代烷基、二(C₁-C₆-卤代烷基)氨基、二-C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷基氨基羰基氨基、C₁-C₆-卤代烷氧基-C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷基氨基羰基-C₁-C₆-烷基氨基、三-C₁-C₆-烷基甲硅烷基-C₂-C₆-炔基氧基、三-C₁-C₆-烷基甲硅烷基氧基、三-C₁-C₆-烷基甲硅烷基-C₂-C₆-炔基、氰基(C₁-C₆-烷氧基)-C₁-C₆-烷基、二-C₁-C₆-烷基硫基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基磺酰基、C₃-C₈-卤代环烷氧基羰基、C₁-C₆-烷基-C₃-C₈-环烷基羰基、C₃-C₈-卤代环烷基羰基、C₂-C₆-烯基氧基羰基、C₂-C₆-炔基氧基羰基、C₁-C₆-氰基烷氧基羰基、C₁-C₆-烷基硫基-C₁-C₆-烷氧基羰基、C₂-C₆-炔基羰基氧基、C₂-C₆-卤代炔基羰基氧基、氰基羰基氧基、C₁-C₆-氰基烷基羰基氧基、C₃-C₈-环烷基磺酰基氧基、C₃-C₈-环烷基-C₁-C₆-烷基磺酰基氧基、C₃-C₈-环烷基磺酰基氧基、C₂-C₆-烯基磺酰基氧基、C₂-C₆-炔基磺酰基氧基、C₁-C₆-氰基烷基磺酰基氧基、C₂-C₆-卤代烯基磺酰基氧基、C₂-C₆-卤代炔基磺酰基氧基、C₂-C₆-炔基环烷氧基、C₂-C₆-氰基烯基氧基、C₂-C₆-氰基炔基氧基、C₁-C₆-烷氧基羰基氧基、C₂-C₆-烯基氧基羰基氧基、C₂-C₆-炔基氧基羰基氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基羰基氧基、磺亚胺、亚砷亚胺和SF₅;

[0109] 和/或其N-氧化物、金属络合物、异构体、多晶型物或农业上可接受的盐;

[0110] 条件是以下化合物被排除在通式(I)化合物的定义之外;

[0111] N-(2-甲氧基乙基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺和6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯。

[0112] 在一个实施方式中,本发明提供了一种通式(I)的化合物,其中

[0113] R¹选自CF₃、CHF₂、CF₂Cl、CF₂CF₃、CH₂F、CH₂CF₃、CHClCF₃和CCl₂CF₃;

[0114] L¹是直接键,-CR²R³-;

[0115] A是在一个或多个桥头处具有N的稠合杂双环;其中所述环任选地被一个或多个相同或不同的R^A基团取代;

[0116] R^A选自氢、卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、SF₅、C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-环烷基、C₃-C₈-环烷基烷基和C₁-C₆-卤代烷基;

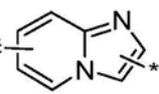
[0117] R⁸和R⁹独立地选自氢、卤素、氰基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-环烷基和C₁-C₆-烷基硫基;或者

[0118] R⁸和R⁹与它们所键合的原子一起形成C(=O)或乙烯基或饱和的单环3-至7-元杂环或碳环,其中,杂环的环成员包括C、N、O和S(O)₀₋₂;并且其中乙烯基、杂环或碳环未被取代或被一个或多个相同或不同的R^{8b}取代,其中R^{8b}选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷基硫基、C₁-C₆-卤代烷基硫基和C₃-C₈-环烷基。

[0119] 在另一个实施方式中,本发明提供了一种通式(I)的化合物,其中

[0120] R¹选自CF₃、CHF₂、CF₂Cl、CHClCF₃和CCl₂CF₃;

[0121] L^1 是直接键；

[0122] A是，其中“#”和“*”表示连接点并且所述环任选地被一个或多个相同

或不同的 R^A 基团取代；

[0123] R^A 选自氢、卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、 SF_5 、 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_8 -环烷基、 C_3-C_8 -环烷基烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_6 -羟基烷基；

[0124] R^8 和 R^9 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基和 C_3-C_8 -环烷基；或者

[0125] R^8 和 R^9 与它们所结合的原子一起形成 $C(=O)$ 或乙烯基。

[0126] 在优选的实施方案中，通式(I)化合物选自：

[0127] N-(3-甲氧基苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(4-甲氧基苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(对甲苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(3-氟苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(2,4-二氟苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(4-氯苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(2-氟苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(4-(三氟甲基)苄基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(吡啶-3-基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-苄基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(吡啶-4-基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(4-氯苯基)-N-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-甲基-N-(2-苯氧基乙基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(4-氰基苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(3-甲氧基苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(2,4-二氟苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(4-氯苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(对甲苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(2-氟苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(4-甲氧基苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-苄基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(3-氟苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N,N-二甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(4-氯-2-氟苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(4-氟-2-氟苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(2-甲氧基苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺；N-(吡啶-3-

基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(2,6-二氟苄基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(3-氟苄基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(吡啶-4-基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;氮杂环丁烷-1-基(7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲酮;N-(2-甲氧基乙基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-异丁基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-新戊基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-异戊基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(4-氯苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(4-甲氧基苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(3-氯苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(3-甲氧基苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(2-氟苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(4-(二甲基氨基)苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(3,4-二氯苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯氢溴酸盐;3-(2-(((3-甲氧基苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-氯苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-氟苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-甲氧基苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((苄基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((2-氟苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;5-(三氟甲基)-3-(2-(((4-(三氟甲基)苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-甲氧基苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((丙基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-氯苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-甲氧基苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-氟苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((苄基磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((2-氟苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-甲氧基苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((丙基磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;5-(三氟甲基)-3-(2-(((4-(三氟甲基)苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-1,2,4-噁二唑;6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(4-(三氟甲基)苄基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;吗啉(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲酮;N-(2-甲氧基乙基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-异丁基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-环戊基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;

(3-甲氧基吡咯烷-1-基)(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲酮;氮杂环丁烷-1-基(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲酮;N-(环丙基甲基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-苄基-N-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(1-苄乙基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(1-氰基环丙基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(2-甲氧基乙基)-N-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(3-氯苄基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(3-甲氧基苄基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(4-氯苄基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-异丁基-N-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯;3-(2-(乙氧基甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;4-甲氧基-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;4-氯-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;2-(4-氯苄基)-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)乙酰胺;3-氯-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;3,4-二氯-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)吡啶酰胺;N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)丙酰胺;4-(三氟甲氧基)-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;4-氟-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;2-氟-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)噁唑-4-甲酰胺;3-氟-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;2-苄基-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)乙酰胺;4-(二甲基氨基)-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;3-甲基-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)丁酰胺;4-(三氟甲基)-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺;N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)烟酰胺;N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)异烟酰胺;3-(2-(((4-甲氧基苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((苯基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-氯苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((3-氯苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((3-氟苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-氟苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二

唑;3-(2-((2-氟苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((丙基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((苄基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-甲氧基苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((3,4-二氯苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((3,5-二氯苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((异丁基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((环戊基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((环己基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((2-乙基苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((苯基磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((3,4-二氯苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((3-氯苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-氯苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((3-氟苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-氟苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-甲氧基苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-((环己基磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((2-氟苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((4-甲氧基苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((3,4-二氯苯基)亚磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((3-氯苯基)亚磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;3-(2-(((2-氟苯基)亚磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑;N-(甲基(氧代)(苯基)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(2-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(3-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(4-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(3-甲氧基苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(二甲基(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(1-氧代四氢-2H-1 λ^6 -噻喃-1-亚基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(4-氯苯基)(2-甲氧基乙基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(异丙基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(4-甲氧基苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(甲基(氧代)(4-(三氟甲基)苯基)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(3,5-二氯苯基)(甲基)(氧代)-

λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(1-氧代四氢-1 λ^6 -噻吩-1-亚基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-((4-溴苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-((3,4-二氯苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(4-氧代-1,4 λ^6 -氧硫杂环己烷-4-亚基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-((2-甲氧基苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-((4-甲氧基吡啶-2-基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-((4-氯苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-(甲基(氧代)(邻甲苯基)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-((3-氯苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;(3-氟苯基)(甲基)((2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)丁酰胺;亚氨基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砷;N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)新戊酰胺;4-甲氧基-N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺;N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺;4-氯-2-氟-N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺;3-氟-N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺;3-氯-N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺;4-氯-N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺;N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)-4-(三氟甲氧基)苯甲酰胺;N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)-2-(三氟甲基)苯甲酰胺;N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)-3-(三氟甲基)苯甲酰胺;2-氟-N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺;亚氨基(苯基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砷;亚氨基(4-甲氧基苯基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砷;(4-氯苯基)(亚氨基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砷;(4-氟苯基)(亚氨基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砷;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(4-甲氧基苄基)(甲基)- λ^6 -亚砷;((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)

((1-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基)- λ^6 -亚砜; (4-氯苄基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)((1-甲基-1H-1,2,4-三唑-3-基)甲基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)(苄基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(2,4-二氟苄基)(甲基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(4-氟苄基)(甲基)- λ^6 -亚砜; 叔丁基((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)(3,3,3-三氟丙基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)((1-甲基-1H-咪唑-4-基)甲基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)二甲基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(环丙基甲基)(甲基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(2,6-二氯苄基)(甲基)- λ^6 -亚砜; (2-氯-4-氟苄基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砜; (2-氯-4-(三氟甲基)苄基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)(4-(三氟甲氧基)苄基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)(4-甲基苄基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(4-甲氧基苄基)(甲基)- λ^6 -亚砜; 苄基((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)(吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(异噁唑-4-基甲基)(甲基)- λ^6 -亚砜; ((1,2,4-噁二唑-3-基)甲基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)(噁唑-4-基甲基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)(噁唑-4-基甲基)- λ^6 -亚砜; (2-氯-6-甲氧基苄基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)(噁唑-5-基)- λ^6 -亚砜; (3-氯-4-(三氟甲基)苄基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(异丙基)(甲基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(乙基)(甲基)- λ^6 -亚砜; ((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(2-甲氧基乙基)(甲基)- λ^6 -亚砜; 2-(7-(5-(氯二氟甲

基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-((4-甲氧基苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;N-((4-氯苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基((1-甲基-1H-1,2,4-三唑-3-基)甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基(氧代)(苄基)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-((2,4-二氟苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-((4-氟苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;N-(叔丁基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基(氧代)(3,3,3-三氟丙基)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基((1-甲基-1H-咪唑-4-基)甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(二甲基(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-((环丙基甲基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-((2,6-二氯苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;N-((2-氯-4-氟苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;N-((2-氯-4-(三氟甲基)苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基(氧代)(4-(三氟甲氧基)苄基)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基(4-甲氧基苄基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-((4-甲氧基苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;N-(苄基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基(氧代)(吡啶-3-基)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-((异噁唑-4-基甲基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;N-(((1,2,4-噁二唑-3-基)甲基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基(噁唑-4-基甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基(氧代)(噁唑-4-基甲基)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;N-((2-氯-6-甲氧基苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基(氧代)(吡啶-5-基)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;N-((3-氯-4-(三氟甲基)苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(异丙基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲

基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(乙基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(2-甲氧基乙基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;2-(7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-N-(甲基((1-甲基-1H-吡唑-4-基)甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)乙酰胺;7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(甲基(氧代)(苯基)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-((4-氯苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-((4-甲氧基苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(甲基(氧代)(间甲苯基)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-((2-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-((2,4-二氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-((3-(二甲基氨基)苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(二甲基(氧代)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(乙基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(叔丁基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-((环丙基甲基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(苜基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(甲基(氧代)(啉啶-5-基)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(甲基(氧代)(哒嗪-4-基)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(甲基(氧代)(吡嗪-2-基)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(甲基(氧代)(吡啶-4-基)- λ^6 -亚硫基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(4-甲氧基苜基)(甲基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)((1-甲基-1H-吡唑-4-基)甲基)- λ^6 -亚砒;(4-氯苜基)((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)((1-甲基-1H-1,2,4-三唑-3-基)甲基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)(苜基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(2,4-二氟苜基)(甲基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(4-氟苜基)(甲基)- λ^6 -亚砒;叔丁基(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)(3,3,3-三氟丙基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)((1-甲基-1H-咪唑-4-基)甲基)- λ^6 -亚砒;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁

二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)二甲基- λ^6 -亚砜;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(环丙基甲基)(甲基)- λ^6 -亚砜;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(2,6-二氯苯基)(甲基)- λ^6 -亚砜;(2-氯-4-氟苯基)(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砜;(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砜;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(4-(三氟甲氧基)苯基)- λ^6 -亚砜;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)(4-甲基苄基)- λ^6 -亚砜;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(4-甲氧基苄基)(甲基)- λ^6 -亚砜;苄基(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砜;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)(吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(异噁唑-4-基甲基)(甲基)- λ^6 -亚砜;((1,2,4-噁二唑-3-基)甲基)(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砜;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)(噁唑-4-基甲基)- λ^6 -亚砜;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)(噁唑-4-基甲基)- λ^6 -亚砜;(2-氯-6-甲氧基苄基)(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砜;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)(噁唑-5-基)- λ^6 -亚砜;(3-氯-4-(三氟甲基)苄基)(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砜;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(异丙基)(甲基)- λ^6 -亚砜;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(乙基)(甲基)- λ^6 -亚砜;(((7-(5-(氯二氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(2-甲氧基乙基)(甲基)- λ^6 -亚砜;(4-甲氧基苄基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((1-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(4-氯苄基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((1-甲基-1H-1,2,4-三唑-3-基)甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(苄基)- λ^6 -亚砜;(2,4-二氟苄基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(4-氟苄基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;叔丁基(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(3,3,3-三氟丙基)- λ^6 -亚砜;甲基((1-甲基-1H-咪唑-4-基)甲

基) ((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;二甲基((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(环丙基甲基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(2,6-二氯苯基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(2-氯-4-氟苯基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(2-氯-4-(三氟甲基)苯基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(4-(三氟甲氧基)苯基)- λ^6 -亚砜;甲基((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(4-甲基苄基)- λ^6 -亚砜;(4-甲氧基苯基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;苄基(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;(异噁唑-4-基甲基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;((1,2,4-噁二唑-3-基)甲基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(噁唑-4-基甲基)- λ^6 -亚砜;甲基((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(噁唑-4-基甲基)- λ^6 -亚砜;(2-氯-6-甲氧基苯基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)(噁唑-5-基)- λ^6 -亚砜;(3-氯-4-(三氟甲基)苯基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;异丙基(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;乙基(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(2-甲氧基乙基)(甲基)((2-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(异丙基亚氨基)(甲基)((2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((环丙基甲基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((异噁唑-4-基甲基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((2-甲氧基乙基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;甲基(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)(甲基亚氨基)- λ^6 -亚砜;(乙基亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;甲基(((1-甲基-1H-咪唑-4-基)甲基)亚氨基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;甲基(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)((3,3,3-三氟丙基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;((4-甲氧基苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-

噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;甲基(((1-甲基-1H-吡唑-4-基)甲基)亚氨基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((4-氟苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;甲基(((1-甲基-1H-1,2,4-三唑-3-基)甲基)亚氨基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;甲基(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)(苯基亚氨基)- λ^6 -亚砜;((2,4-二氟苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((4-氟苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((叔丁基亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;甲基(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)(吡啶-3-基亚氨基)- λ^6 -亚砜;((苄基亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((4-甲氧基苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;甲基(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)((4-甲基苄基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)((4-(三氟甲氧基)苄基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;((2-氯-4-(三氟甲基)苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((2-氯-4-氟苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((2,6-二氯苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((2-氯-6-甲氧基苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;甲基(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)((噻唑-4-基甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)((噁唑-4-基甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(((1,2,4-噁二唑-3-基)甲基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;甲基(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)(噻唑-5-基亚氨基)- λ^6 -亚砜;((3-氯-4-(三氟甲基)苄基)亚氨基)(甲基)(2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)- λ^6 -亚砜;((异丙基亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((环丙基甲基)亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((异噁唑-4-基甲基)亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((2-甲氧基乙基)亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基(甲基亚氨基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((乙基亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基(((1-甲基-1H-咪唑-4-基)甲基)亚氨基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)((3,3,3-

三氟丙基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;((4-甲氧基苄基)亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基(((1-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基)亚氨基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((4-氯苄基)亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基(((1-甲基-1H-1,2,4-三唑-3-基)甲基)亚氨基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基(苄基亚氨基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((2,4-二氟苄基)亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((4-氟苄基)亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((叔丁基亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基(吡啶-3-基亚氨基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((苄基亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((4-甲氧基苄基)亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基((4-甲基苄基)亚氨基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基((4-(三氟甲氧基)苄基)亚氨基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((2-氯-4-(三氟甲基)苄基)亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((2-氯-4-氟苄基)亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((2,6-二氯苄基)亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((2-氯-6-甲氧基苄基)亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基((噻唑-4-基甲基)亚氨基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基((噁唑-4-基甲基)亚氨基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;(((1,2,4-噁二唑-3-基)甲基)亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;甲基(嘧啶-5-基亚氨基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;((3-氯-4-(三氟甲基)苄基)亚氨基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜;N-(甲基(氧代)(苄基)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-((4-氯苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-((4-甲氧基苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(甲基(氧代)(间甲苯基)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-((2-氟苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-((2,4-二氟苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-((3-(二甲基氨基)苄基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(二甲基(氧代)-

λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(乙基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(叔丁基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(环丙基甲基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(苄基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(甲基(氧代)(噻啶-5-基)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(甲基(氧代)(哒嗪-4-基)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(甲基(氧代)(吡嗪-2-基)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;N-(甲基(氧代)(吡啶-4-基)- λ^6 -亚硫基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;甲基(苯基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;(4-氯苯基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;(4-甲氧基苯基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;甲基(间甲苯基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;(2-氟苯基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;(2,4-二氟苯基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;(3-(二甲基氨基)苯基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;二甲基((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;乙基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;叔丁基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;(环丙基甲基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;苄基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;甲基(噻啶-5-基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;甲基(哒嗪-4-基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;甲基(吡嗪-2-基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;甲基(吡啶-4-基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;甲基(苯基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;甲基(3-甲基苄基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;甲基(吡啶-4-基甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;甲基(噻啶-4-基甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;甲基(吡啶-3-基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;甲基(吡啶-2-基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷;甲基((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(5-(三氟甲基)吡啶-2-基)- λ^6 -亚砷;(5-甲氧

基吡啶-2-基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(5-氟吡啶-2-基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(咪啶-5-基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(哒嗪-4-基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(1-甲基-1H-吡啶-4-基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;异噁唑-4-基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(2-甲氧基噻唑-4-基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;二甲基((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;乙基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;叔丁基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(环丙基甲基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(3,3,3-三氟丙基)- λ^6 -亚砜;(2-甲氧基乙基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;苄基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(3-甲氧基苄基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(3-氟苄基)(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;异丙基(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(环丙基甲基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(异噁唑-4-基甲基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(2-甲氧基乙基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;二甲基((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;乙基(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((1-甲基-1H-咪唑-4-基)甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)(3,3,3-三氟丙基)- λ^6 -亚砜;(4-甲氧基苄基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((1-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(4-氯苄基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基((1-甲基-1H-1,2,4-三唑-3-基)甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;甲基(苯基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砜;(2,4-二氟苄基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -

亚砷; (4-氟苯基) (甲基) (((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷; 叔丁基(甲基) (((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷; 甲基(吡啶-3-基) (((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷; 苄基(甲基) (((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷; (4-甲氧基苯基) (甲基) (((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷; 甲基(4-甲基苄基) (((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷; 甲基(4-(三氟甲氧基)苯基) (((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷; (2-氯-4-(三氟甲基)苯基) (甲基) (((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷; (2-氯-4-氟苯基) (甲基) (((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷; (2,6-二氯苯基) (甲基) (((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷; (2-氯-6-甲氧基苯基) (甲基) (((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷; 甲基(噁唑-4-基甲基) (((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷; 甲基(噁唑-4-基甲基) (((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷; ((1,2,4-噁二唑-3-基)甲基) (甲基) (((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷; 甲基(啉啉-5-基) (((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷和(3-氯-4-(三氟甲基)苯基) (甲基) (((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷。

[0128] 本发明的化合物可以作为一种或多种立体异构体存在。各种立体异构体包括对映异构体、非对映异构体、阻转异构体和几何异构体。本领域的技术人员将理解,当相对于其他立体异构体富集或与其他立体异构体分离时,一种立体异构体可能更具活性和/或可能表现出有益效果。此外,技术人员知道如何分离、富集和/或选择性地制备所述立体异构体。本发明的化合物可以作为立体异构体的混合物、单独的立体异构体或作为光学活性的形式存在。

[0129] 在通式I的化合物是阳离子或能够形成阳离子的情况下,盐的阴离子部分可以是无机的或有机的。或者,在通式(I)化合物为阴离子或能够形成阴离子的情况下,盐的阳离子部分可以是无机的或有机的。盐的无机阴离子部分的实例包括但不限于氯离子、溴离子、碘离子、氟离子、硫酸根、磷酸根、硝酸根、亚硝酸根、碳酸氢根和硫酸氢根。盐的有机阴离子部分的实例包括但不限于甲酸根、烷酸根、碳酸根、乙酸根、三氟乙酸根、三氯乙酸根、丙酸根、乙醇酸根、硫氰酸根、乳酸根、琥珀酸根、苹果酸根、柠檬酸根、苯甲酸根、肉桂酸根、草酸根、烷基硫酸根、烷基磺酸根、芳基磺酸根、芳基二磺酸根、烷基膦酸根、芳基膦酸根、芳基二膦酸根、对甲苯磺酸根和水杨酸根。盐的无机阳离子部分的实例包括但不限于碱金属和碱土金属。盐的有机阳离子部分的实例包括但不限于吡啶、甲基胺、咪唑、苯并咪唑、组氨酸(histidine)、磷脒、四甲基铵、四丁基铵、胆碱和三甲基胺。

[0130] 式(I)化合物的金属络合物中的金属离子可特别是第二主族元素的离子,尤其是

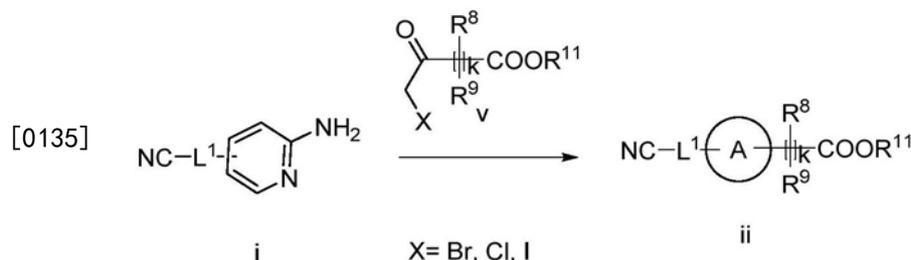
钙和镁,第三和第四主族元素的离子,尤其是铝、锡和铅,以及第一至第八过渡族的离子,特别是铬、锰、铁、钴、镍、铜、锌等。特别优选第四周期和第一至第八过渡族的元素的金属离子。在这里,金属可以以它们可以承担的各种化合价存在。

[0131] 选自通式(I)的化合物(包括其所有立体异构体、N-氧化物和盐)通常可以以多于一种的形式存在。因此,通式I包括通式(I)代表的化合物的所有结晶和非结晶形式。非结晶形式包括固体如蜡状物和胶状物的实施方式以及液体如溶液和熔体的实施方式。结晶形式包括基本上代表单晶类型的实施方式和代表多晶型物的混合物(即不同结晶类型)的实施方式。术语“多晶型物”是指可以以不同晶型结晶的化合物的特定晶型,这些晶型在晶格中具有不同的分子排列和/或构象。尽管多晶型物可以具有相同的化学组成,但由于在晶格中或弱或强地结合的共结晶水或其他分子的存在或不存在,它们的组成也可能不同。多晶型物的化学、物理和生物性质可能不同,例如晶体形状、密度、硬度、颜色、化学稳定性、熔点、吸湿性、悬浮性、溶解速率和生物利用度。本领域技术人员将理解,由通式(I)表示的化合物的多晶型物相对于另一种由通式(I)表示的相同化合物的多晶型物或多晶型物的混合物可以表现出有益效果(例如,适用于制备有用的制剂、改善的生物性能)。通式(I)表示的化合物的特定多晶型物的制备和分离可以通过本领域技术人员已知的方法实现,包括,例如,使用选定的溶剂和温度进行结晶。

[0132] 在一个实施方式中,本发明提供了一种制备通式(I)化合物的方法。

[0133] 在一个实施方式中,本发明提供了一种制备通式(I)化合物的方法,包括以下步骤:

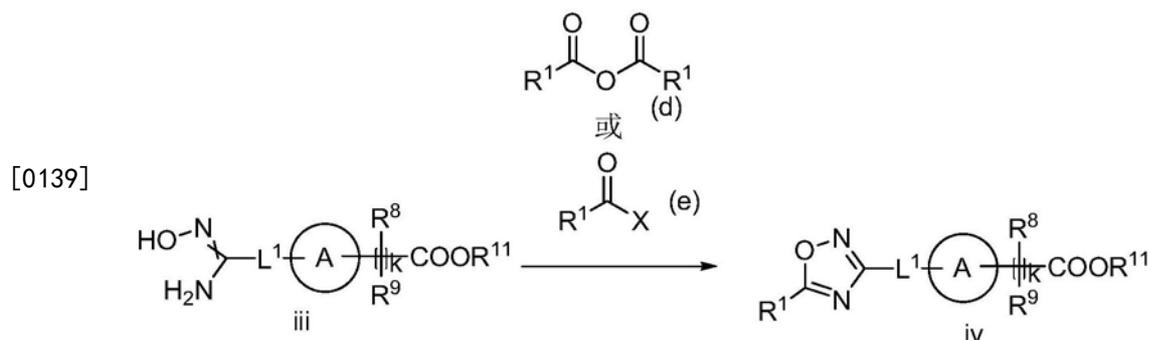
[0134] a) 使式i的化合物与式v的 α -卤代羰基化合物反应以得到式ii化合物;



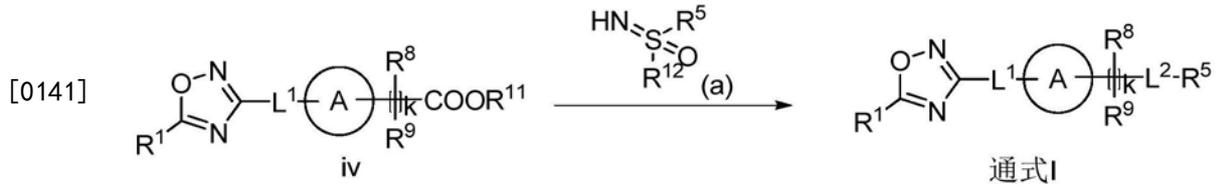
[0136] b) 使式ii化合物与羟胺反应以得到式iii化合物;

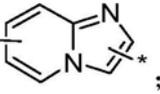


[0138] c) 使式iii化合物与式(d)的酸酐或式(e)的酰氯化合物反应以得到式iv化合物;



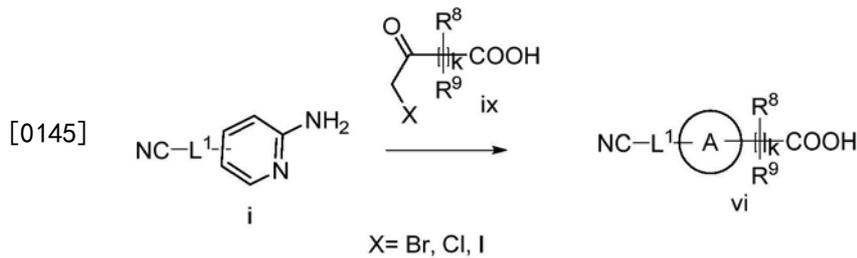
[0140] d) 使式iv化合物与式(a)的亚砷亚胺化合物反应得到通式(I)化合物;



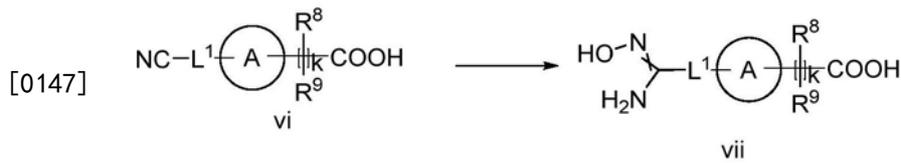
[0142] 其中, L¹为直接键; A是# ; R¹、k、R⁸、R⁹、L²和R⁵如以上详细描述中所定义。

[0143] 在另一个实施方式中, 本发明提供了一种制备通式(I)化合物的方法, 包括以下步骤:

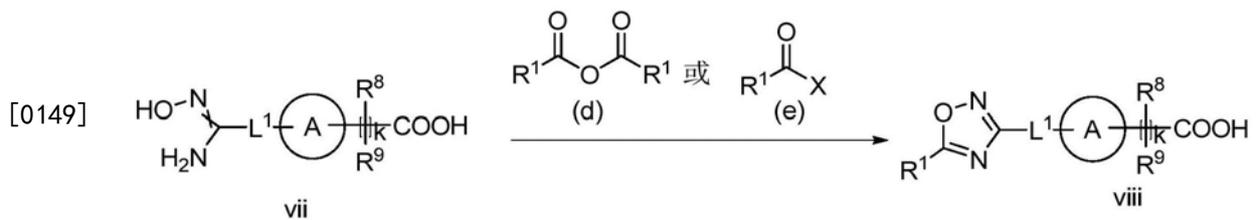
[0144] a) 使式i的化合物与式ix的化合物反应以得到式vi化合物;



[0146] b) 使式vi化合物与羟胺反应以得到式vii化合物;

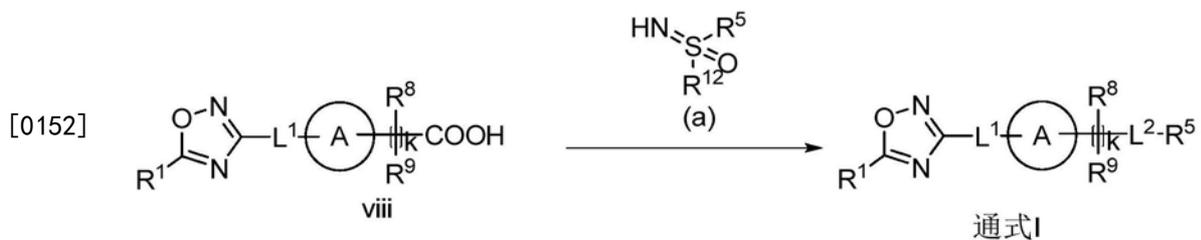


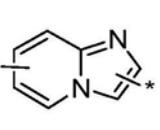
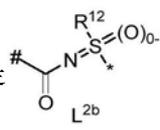
[0148] c) 使式vii化合物与式(d)的酸酐或式(e)的酰氯化合物反应以得到式viii化合物;



[0150] 其中, X=Br、Cl或I;

[0151] d) 使式viii化合物与式(a)的化合物反应得到通式(I)化合物;

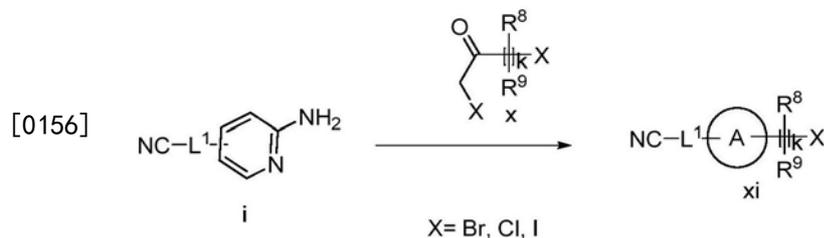


[0153] 其中, L¹为直接键; A是# ; 且L²是# ; R¹、k、R⁸、R⁹和R⁵如以上详

细描述中所定义。

[0154] 在又一个实施方式中,本发明提供了一种制备通式(I)化合物的方法,包括以下步骤:

[0155] a) 使式i的化合物与式x的化合物反应以得到式xi化合物;

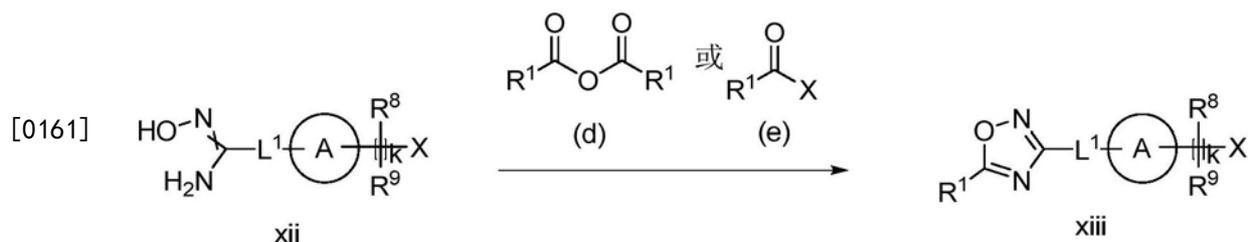


[0157] b) 使式xi化合物与羟胺反应以得到式xii化合物;



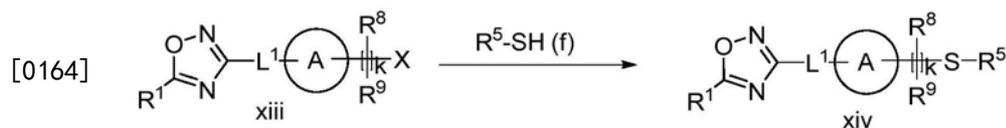
[0159] 其中,X为Cl、Br、I;

[0160] c) 使式xii化合物与式(d)的酸酐或式(e)的酰氯化合物反应以得到式xiii化合物;

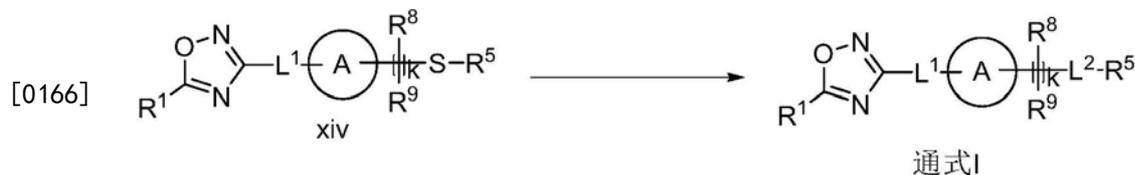


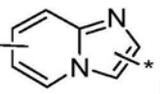
[0162] 其中,X为Cl、Br、I;

[0163] d) 使式xiii化合物与式(f)的化合物反应得到式xiv化合物;



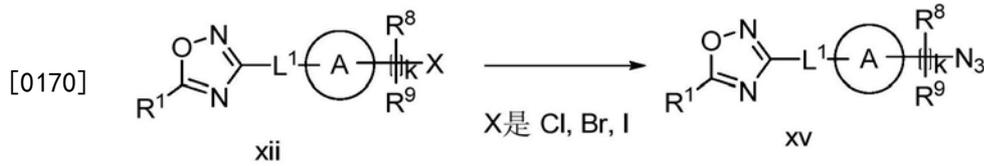
[0165] e) 将式xiv化合物用合适的氧化剂氧化,得到通式(I)化合物;



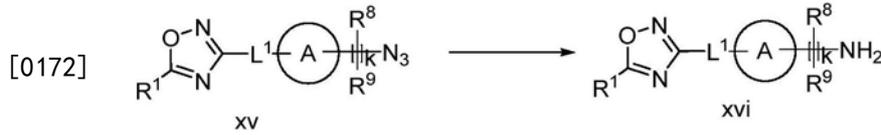
[0167] 其中,L¹为直接键;A是; L²是-S(=O)₀₋₂⁻;R₁、k、R⁸、R⁹和R⁵如以上详细描述中所定义。

[0168] 在又一个实施方式中,本发明提供了一种制备通式(I)化合物的方法,包括以下步骤:

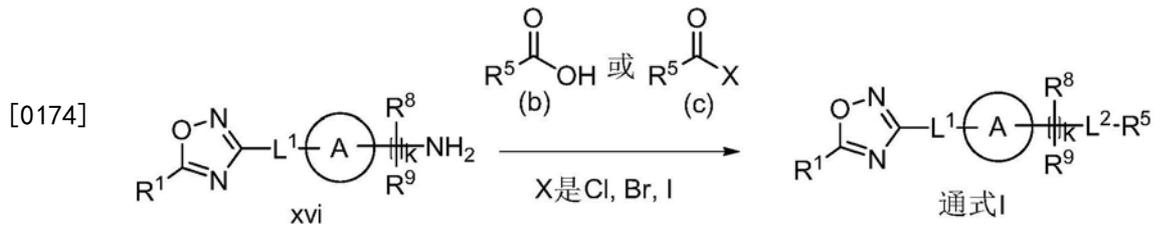
[0169] a) 使式xii化合物与合适的碱金属叠氮化物反应以得到式xv化合物;

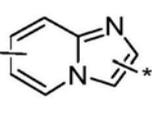
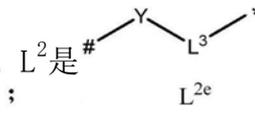


[0171] b) 使式xv化合物与合适的还原剂反应以得到式xvi化合物;



[0173] c) 使式xvi化合物与式 (b) 的羧酸或式 (c) 的酰氯化合物反应以得到通式 (I) 的化合物;



[0175] 其中, L¹为直接键; A是 ; L²是  其中, Y是 -NR¹⁰, 并且 L³是 C

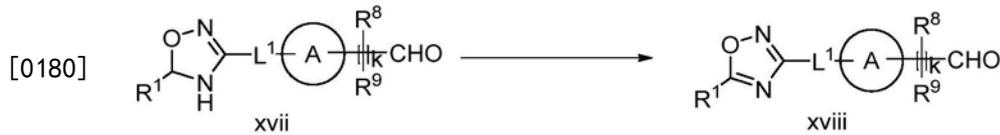
(=O) - ; R¹, k, R⁸, R⁹和R⁵如以上详细描述中所定义。

[0176] 在又一个实施方式中, 本发明提供了一种制备通式 (I) 化合物的方法, 包括以下步骤:

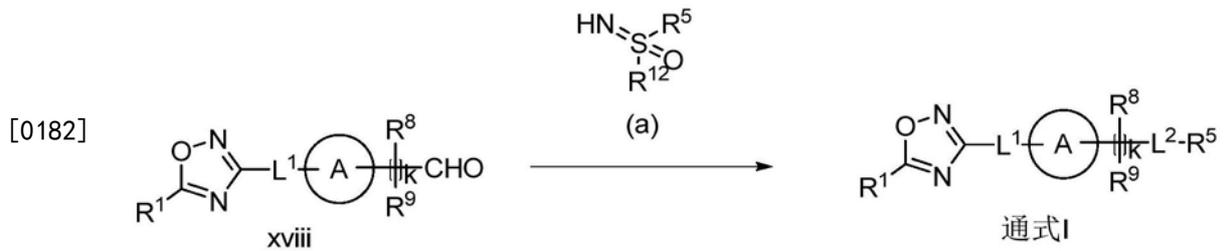
[0177] a) 使式iv化合物与合适的还原剂反应以得到式xvii化合物;

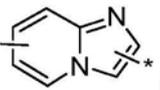
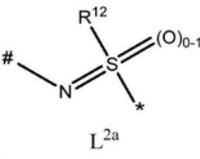


[0179] b) 使式xvii化合物与合适的氧化剂反应以得到式xviii化合物;



[0181] c) 使式xviii的化合物与式 (a) 的亚砷亚胺化合物反应以得到通式 (I) 的化合物;



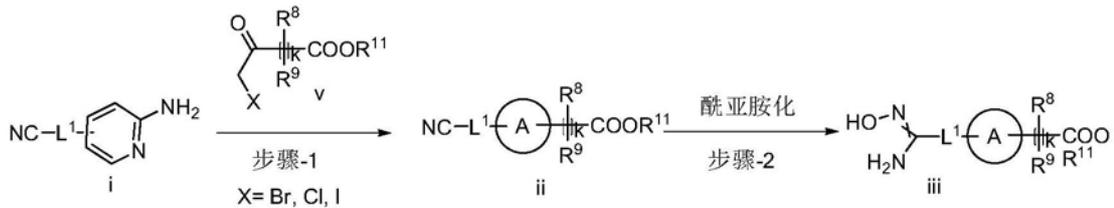
[0183] 其中, L^1 为直接键; A 是 ; L^2 是 ; R^1 、 k 、 R^8 、 R^9 和 R^5 如以上详

细描述中所定义。

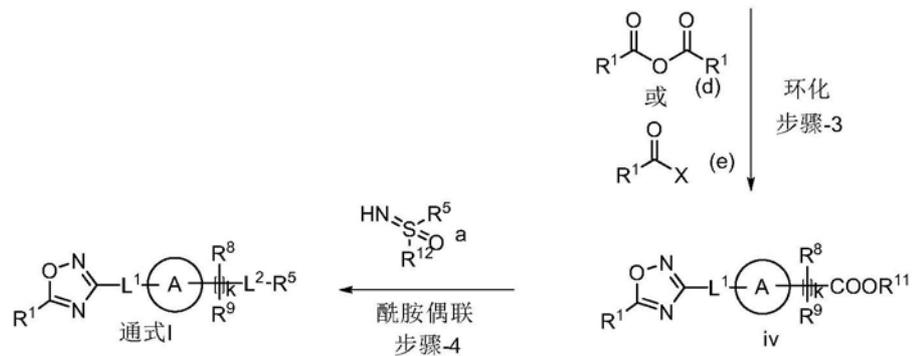
[0184] 可以通过已知的方式以如反应式1-5中所描述的各种方式制备由通式(I)所定义的和/或在表1至12中的本发明的化合物。

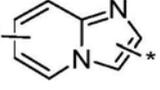
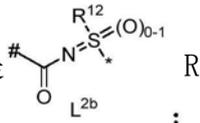
[0185] 通式(I)化合物可通过使用反应式1中描述的方法制备:

[0186] 反应式1:-



[0187]



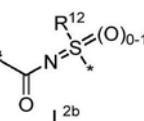
[0188] 其中, L^1 为直接键; A 是 ; L^2 是 ; R^1 、 k 、 R^8 、 R^9 和 R^5 如以上详细

描述中所定义。

[0189] 式ii化合物可以通过使式i的2-氨基吡啶化合物和式v的 α -卤代羰基化合物在极性质子溶剂(如乙醇)的存在下,任选在酸(如乙酸)的存在下在回流温度下反应来制备。

[0190] 式iii化合物可通过式ii化合物与羟胺在极性质子溶剂(如乙醇、甲醇等)存在下,在环境温度至60°C下反应来制备。该反应也可以在如四氢呋喃、1,4-二噁烷等溶剂中进行。

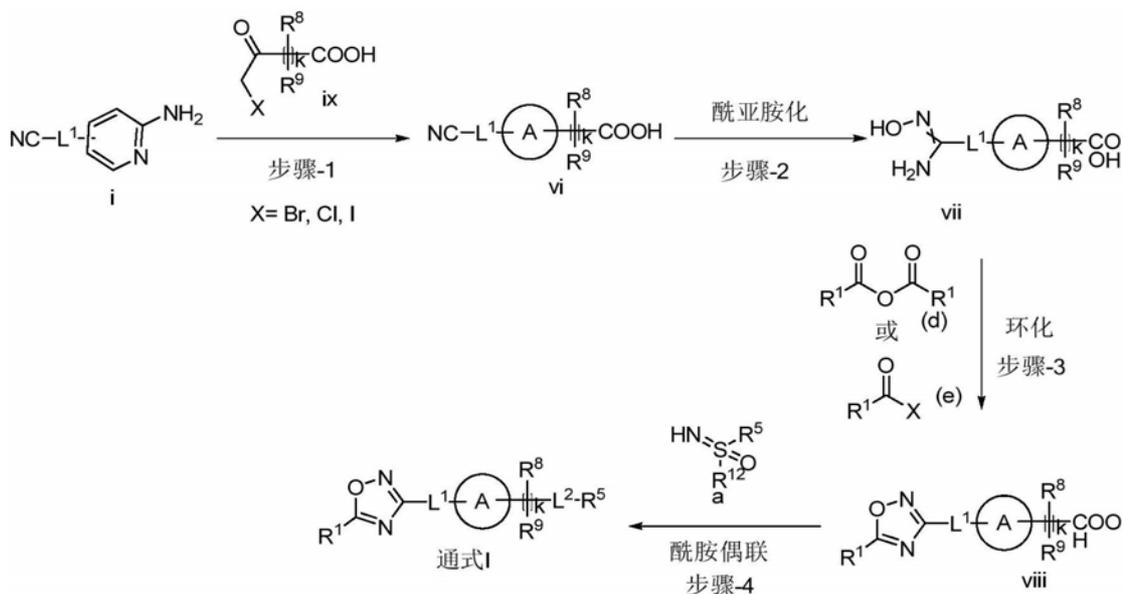
[0191] 式iv化合物可通过使式iii化合物与式(d)酸酐任选地在有机碱(如三乙基胺或N,N-二异丙基乙基胺)的存在下反应来制备。或者,式iii化合物可与式(e)的酰氯化物任选地在有机碱(如三乙基胺、N,N-二异丙基乙基胺等)的存在下反应以获得期望的式iv化合物。通常,该反应在非质子溶剂(如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷等)中在0-60°C的温度下进行。

[0192] 其中 L^2 为  的通式I的化合物可通过使式iv的酯化合物与式(a)的亚砷

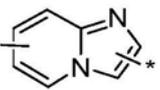
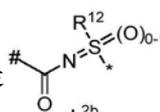
亚胺化合物使用三甲基铝作为偶联剂反应而得到。该反应可在如甲苯、四氢呋喃或1,4-二噁烷的溶剂中在0-110℃下进行。

[0193] 或者,通式(I)的化合物也可以通过使用如反应式2中描述的方法制备:

[0194] 反应式:2



[0195]

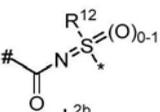
[0196] 其中, L¹为直接键; A是 ; L²是 ; R¹、k、R⁸、R⁹和R⁵如以上详细描述中所定义。

描述中所定义。

[0197] 式vi化合物可通过使式i化合物与式ix化合物任选地在有机酸(如乙酸)的存在下反应而获得。该反应可以在如四氢呋喃或1,4-二噁烷的溶剂中在25℃至回流温度的温度下进行。

[0198] 式vii化合物可通过使式vi化合物与羟胺在非质子溶剂(如四氢呋喃、1,4-二噁烷等)中在0-60℃下反应而得到。

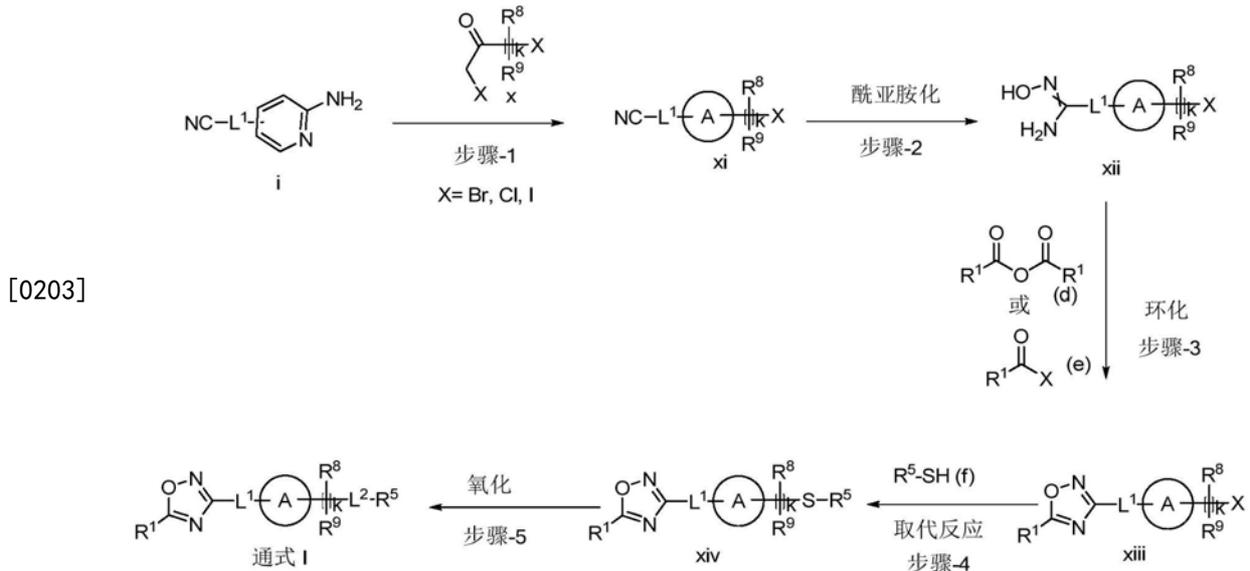
[0199] 式viii化合物可通过使式vi化合物与式(d)的酸酐任选在碱(如三乙基胺、二异丙基乙基胺等)的存在下反应制备。或者,式vii化合物可与式(e)的酰氯化物任选地在有机碱(如三乙基胺、二异丙基乙基胺等)的存在下反应以得到期望的式viii化合物。通常,该反应在非质子溶剂(如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷等)中在0-60℃的温度下进行。

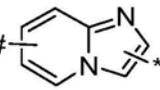
[0200] 其中L²为  的通式I的化合物可通过使用酰胺偶联剂(如1-乙基-3-(3-

二甲基氨基丙基)碳二亚胺(在4-二甲基氨基吡啶的存在下)、1-[双(二甲基氨基)亚甲基]-1H-1,2,3-三唑并[4,5-b]吡啶鎓3-氧化物六氟磷酸盐(HATU)等)使式vii的酸化合物与式(a)的亚砷亚胺化合物在溶剂(二氯甲烷、四氢呋喃、二甲基甲酰胺等)中反应而获得。该反应可在0-60℃下进行。

[0201] 或者,通式(I)的化合物也可以通过使用如反应式3中描述的方法制备:

[0202] 反应式:3



[0204] 其中, L¹为直接键; A是 ; L²是 -S(=O)₀₋₂; R¹、k、R⁸、R⁹和R⁵如以上详细描述中所定义。

[0205] 式xi化合物可通过使式i化合物与式x化合物在极性质子溶剂(如乙醇、甲醇等)中反应而得到。

[0206] 式xii化合物可以通过式xi化合物与羟胺在如乙醇、甲醇等的溶剂中反应而得到。该反应可以在0-60℃的温度下进行。

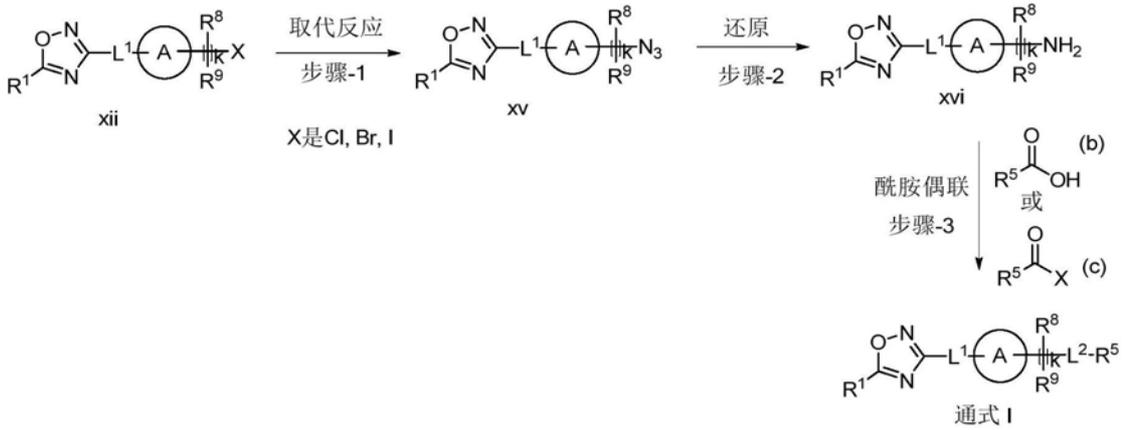
[0207] 式xiii的化合物可以通过将式xii的化合物与式(d)的酸酐或式(e)的酰氯在如四氢呋喃、二氯甲烷或1,4-二噁烷的溶剂中环化而得到。该反应可以在0-60℃的温度下任选地在有机碱(如三乙胺或二异丙基乙基胺)的存在下进行。

[0208] 式xiv化合物可通过使式xiii化合物与式(f)的硫醇化合物在碱(如碳酸钾、碳酸铯)的存在下反应而得到。该反应可在乙腈、N,N-二甲基甲酰胺、二甲基亚砷等溶剂中进行。

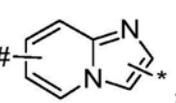
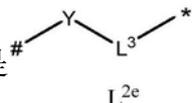
[0209] 其中L²是 -S(=O)₀₋₂的通式I的化合物可通过使式xiv的硫化物化合物通过适当当量的氧化剂(如单过硫酸氢钾(oxone), 间氯过苯甲酸)氧化而得到。该反应可以在如二氯甲烷的溶剂中在0℃至35℃的温度下进行。

[0210] 在一个实施方式中, 通式(I)的化合物可以通过使用如反应式4中描述的方法来制备:

[0211] 反应式:4

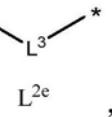


[0212]

[0213] 其中, L^1 为直接键; A 是 ; L^2 是  其中 Y 是 $-NR^{10}$ 并且 L^3 是 $-C(=O)-$; R^1, k, R^8, R^9 和 R^5 如以上详细描述中所定义。

[0214] 式 xv 的叠氮化物可通过使式 xii 的化合物与碱金属叠氮化物 (如叠氮化钠、叠氮化钾等) 在极性非质子溶剂 (如 N,N-二甲基甲酰胺、二甲基亚砷等) 中反应而得到。该反应可以在 $0-60^\circ C$ 的温度下进行。

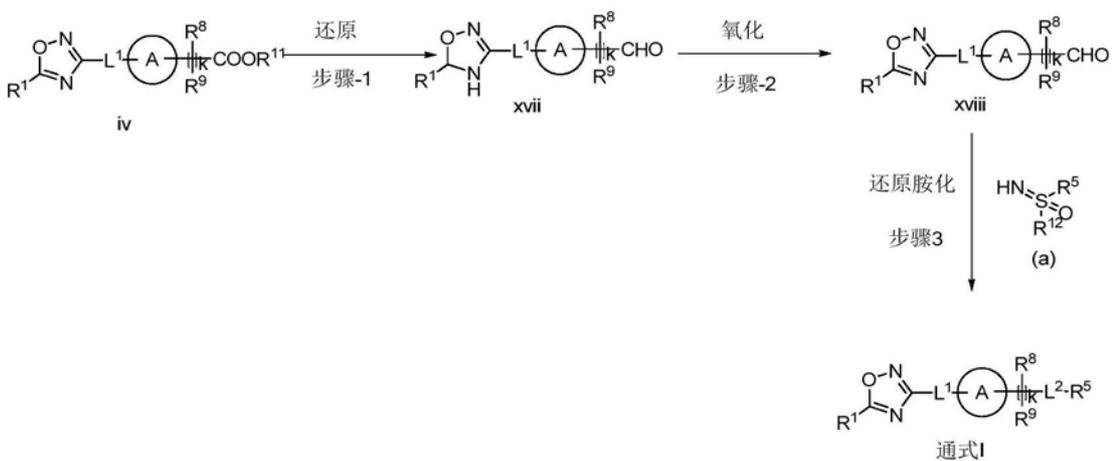
[0215] 式 xvi 的胺化合物可以在三苯基膦和水的存在下, 通过施陶丁格 (staudinger) 反应条件, 使式 xv 的叠氮化合物反应而合成。该反应可以在如四氢呋喃的溶剂中进行。

[0216] 其中 L^2 是  其中 Y 是 $-NR^{10}$ 且 L^3 是 $-C(=O)-$ 的通式 (I) 的化合物可以通过

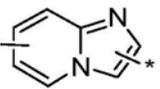
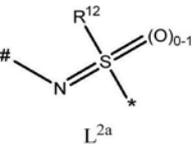
使用合适的偶联剂 (如 1-乙基-3-(3-二甲基氨基丙基) 碳二亚胺-羟基苯并三唑或 1-[双(二甲基氨基)亚甲基]-1H-1,2,3-三唑并[4,5-b]吡啶鎓 3-氧化物六氟磷酸盐等) 的常规的酰胺偶联反应在有机碱 (如三乙基胺或二异丙基乙基胺) 的存在下, 使式 xvi 的胺化合物与式 (b) 的羧酸反应来制备。或者, 通式 (I) 的化合物也可以通过在有机碱 (如三乙胺或二异丙基乙基胺或吡啶等) 的存在下使式 xvi 的胺化合物与式 c 的羧酰氯反应而得到。

[0217] 在另一个实施方式中, 通式 (I) 的化合物可以通过使用如反应式 5 中描述的方法来制备:

[0218] 反应式: 5



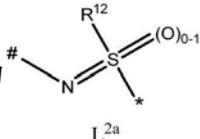
[0219]

[0220] 其中, L^1 为直接键; A 是 ; L^2 是 ; R^1 、 k 、 R^8 、 R^9 和 R^5 如以上详

细描述中所定义。

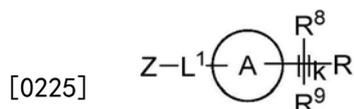
[0221] 式 xvii 化合物可以通过用合适的还原剂例如氢化二异丁基铝 (DIBAL-H) 还原式 iv 化合物来制备。该反应可以在如二氯甲烷、四氢呋喃等的溶剂中, 在 -78°C 至 -50°C 的温度下进行。

[0222] 式 xviii 的化合物可以通过使用合适的氧化剂 2,3-二氯-5,6-二氰基-1,4-苯醌在 0°C 至 35°C 下在如二氯甲烷的溶剂中氧化式 xvii 的二氢噁二唑化合物来制备。

[0223] 其中 L^2 为  的通式 I 的化合物可以通过使式 xviii 的醛化合物和式 (a)

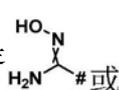
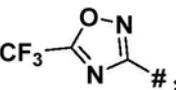
的亚砷亚胺化合物在 125 - 135°C 的温度下的微波辅助还原胺化来制备。

[0224] 在一个实施方式中, 本发明提供了一种通式 (B) 的化合物;

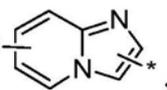


通式(B)

[0226] 其中,

[0227] Z 是  或 ; 其中“#”表示与 L^1 的连接点;

[0228] L^1 是直接键;

[0229] A 是 ;

[0230] R^8 和 R^9 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基和 C_3 - C_8 -环烷基;

[0231] k 是 0 和 1 范围内的整数;

[0232] R 选自氢、叠氮基、卤素、羟基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -卤代烷氧基、 C_1 - C_6 -烷基硫基、 C_1 - C_6 -卤代烷基硫基、 C_3 - C_8 -环烷基、氨基- C_1 - C_6 -烷基、二- C_1 - C_6 -烷基氨基、 NHSO_2 - C_1 - C_6 -烷基、 $-\text{S}(=\text{O})(=\text{NH})$ - C_1 - C_6 -烷基、 $-\text{C}(=\text{O})$ - C_1 - C_6 -烷基、 $\text{C}(=\text{O})$ - C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基、羟基- C_1 - C_6 -烷基、 $-\text{C}(=\text{O})$ - NH_2 、 $\text{C}(=\text{O})$ - $\text{NH}(C_1-C_6\text{-烷基})$ 、 C_1 - C_6 -烷基硫基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基氨基- C_1 - C_6 -烷基、二- C_1 - C_6 -烷基氨基- C_1 - C_6 -烷基、氨基羰基- C_1 - C_6 -烷基和 C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_6 -烷基;

[0233] 条件是以下化合物被排除在通式 (I) 化合物的定义之外;

[0234] (Z)-2-(6-(N' -羟基甲脒基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯, 6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸和 (Z)-2-(7-(N' -羟基甲脒基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯。

[0235] 在一个优选实施方式中,通式(B)的化合物选自7-(N'-羟基甲脒基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸、2-(7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯、7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸、7-(5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲醛、7-(5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲醛、2-(氯甲基)-N'-羟基咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲脒、3-(2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑、3-(2-(叠氮甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑、2-(6-(5-(三氟甲基))-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯、6-(N'-羟基甲脒基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸、2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯、6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲醛、6-(5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲醛、3-(2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑、2-(氯甲基)-N'-羟基咪唑并[1,2-a]吡啶-6-甲脒、3-(2-(叠氮甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑和亚氨基(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砷。

[0236] 在一个实施方式中,本发明涉及一种组合物,其包含通式(I)化合物、其农业上可接受的盐、金属络合物、结构异构体、立体异构体、非对映异构体、对映异构体、手性异构体、阻转异构体、构象异构体、旋转异构体、互变异构体、旋光异构体、多晶型物、几何异构体或N-氧化物,任选地一种或多种附加活性成分,以及辅料,例如惰性载体或任何其他基本成分例如表面活性剂、添加剂、固体稀释剂和液体稀释剂。

[0237] 根据本发明的通式I的化合物和组合物分别适合作为杀真菌剂。它们的特点是对广谱的植物病原真菌具有出色的效果,所述植物病原真菌包括土传真菌,它们尤其来自于根肿菌纲(Plasmodiophoromycetes)、霜霉菌纲(Peronosporomycetes(同义词:卵菌纲(Oomycetes)))、壶菌纲(Chytridiomycetes)、接合菌纲(Zygomycetes)、子囊菌纲(Ascomycetes)、担子菌纲(Basidiomycetes)和半知菌纲(Deuteromycetes(同义词:不完全菌纲(Fungi imperfecti)))。有些是系统性有效的,它们可作为叶面杀菌剂、拌种杀菌剂和土壤杀菌剂被用于作物保护。此外,它们适用于防治有害真菌,这些真菌尤其存在于木材或植物的根中。

[0238] 根据本发明的通式(I)化合物和组合物对各种栽培植物以及植物繁殖材料(例如种子)和这些植物的作物材料在控制多种植物病原真菌方面特别重要,所述栽培植物例如禾谷类,如小麦、黑麦、大麦、黑小麦、燕麦或稻;甜菜,例如糖用甜菜或饲用甜菜;水果,例如梨果、核果或软果,例如苹果、梨、李子、桃、扁桃、樱桃、草莓、树莓、黑莓或醋栗;豆科植物,如扁豆、豌豆、苜蓿或大豆;油料植物,例如油菜、芥菜、橄榄、向日葵、椰子、可可豆、蓖麻油植物、油棕、花生或大豆;葫芦科植物,如南瓜、黄瓜或瓜(melons);纤维植物,如棉花、亚麻、大麻或黄麻;柑橘类水果,如橙、柠檬、葡萄柚或橘;蔬菜,如菠菜、莴苣、芦笋、甘蓝、胡萝卜、洋葱、西红柿、土豆、葫芦或红辣椒;月桂科植物,如鳄梨、肉桂或樟脑;能源和原材料植物,如玉米、大豆、油菜、甘蔗或油棕;玉米;烟草;坚果;咖啡;茶;香蕉;葡萄藤(鲜食葡萄和葡萄汁葡萄藤);蛇麻子;草皮;甜叶(也称为甜叶菊);天然橡胶植物或观赏和林业植物,例如花卉、灌木、阔叶树或常绿植物,例如针叶树。

[0239] 特别地,根据本发明的通式I化合物和组合物对大豆和大豆的植物繁殖材料(如种子)和作物材料在控制植物病原真菌方面是重要的。因此,本发明还包括一种组合物,其包含至少一种通式I化合物和种子。在组合物中通式I化合物的量为每100kg种子0.1gai(克/活性成分)至10kgai(千克/活性成分)。

[0240] 优选地,通式(I)化合物及其组合物分别用于在大田作物上控制多种真菌,所述大田作物例如马铃薯、糖用甜菜、烟草、小麦、黑麦、大麦、燕麦、稻、玉米、棉花、大豆、油菜、豆类、向日葵、咖啡或甘蔗;水果;葡萄藤;观赏植物;或蔬菜,如黄瓜、西红柿、豆类或南瓜。

[0241] 术语“植物繁殖材料”应理解为表示植物的所有生殖或繁殖部分,例如种子和无性生殖植物材料,例如插条和块茎(例如马铃薯),它们可用于植物的繁殖。这包括种子、根、果实、块茎、球茎、根状茎、茎芽、萌枝(sprouts)、芽枝、花、以及植物的其他部分,包括从土壤中发芽或出苗后要移植的幼苗和小苗。

[0242] 这些小苗也可以在移植前通过浸没或浇注的全部或部分处理来保护。

[0243] 优选地,分别用通式I的化合物、其组合和/或组合物处理植物繁殖材料用于防治禾谷类(如小麦、黑麦、大麦和燕麦);稻、玉米、棉花和大豆上的多种真菌。

[0244] 术语“栽培植物”应理解为包括通过育种、诱变或基因工程改造的植物,包括但不限于市场上或开发中的农业生物技术产品(参见<http://cera-gmc.org/>,参见其中的转基因作物数据库(GM crop database))。转基因植物是指其遗传物质已通过使用重组DNA技术进行修饰而在自然环境下无法通过杂交育种、突变或自然重组轻易获得的植物。通常,一种或多种基因已被整合到转基因植物的遗传物质中以改善植物的某些特性。此类遗传修饰还包括但不限于蛋白质、寡肽或多肽的靶向翻译后修饰,例如通过糖基化或聚合物加成,例如异戊二烯化、乙酰化或法尼基化(farnesylated)部分或PEG部分。作为传统育种或基因工程方法的结果,已经通过育种、诱变或基因工程改造的植物,例如已经对特定种类的除草剂的施用具有耐受性,例如生长素除草剂,例如麦草畏或2,4-D;白化除草剂(bleacher herbicides),例如羟苯基丙酮酸双加氧酶(HPPD)抑制剂或八氢番茄红素脱氢酶(PDS)抑制剂;乙酰乳酸合酶(ALS)抑制剂,如磺酰脲类或咪唑啉酮类;烯醇丙酮酸莽草酸-3-磷酸合酶(EPSPS)抑制剂,如草甘膦;谷氨酰胺合成酶(GS)抑制剂,如草铵膦;原卟啉原IX氧化酶抑制剂;脂质生物合成抑制剂,例如乙酰辅酶A羧化酶(ACCCase)抑制剂;或苯腈(即溴苯腈或碘苯腈)除草剂。此外,已经通过多种遗传修饰使植物对多种类型的除草剂产生抗性,例如对草甘膦和草铵膦两者或对草甘膦和另一类除草剂(如ALS抑制剂、HPPD抑制剂、生长素除草剂或ACCCase抑制剂)两者的抗性。这些抗除草剂技术例如描述在Pest Managem.Sci.61,2005,246;61,2005,258;61,2005,277;61,2005,269;61,2005,286;64,2008,326;64,2008,332;Weed Sci.57,2009,108;Austral.J.Agricult.Res.58,2007,708;Science 316,2007,1185;以及其中引用的参考文献中。通过传统的育种方法(诱变),一些栽培植物已对除草剂具有耐受性,例如Clearfield®夏季油菜(summer rape)(Canola,BASF SE,德国)耐受咪唑啉酮类,例如咪草啶酸,或ExpressSun®向日葵(美国杜邦)耐受磺脲类,例如苯磺隆。已经使用基因工程方法使栽培植物如大豆、棉花、玉米、甜菜和油菜耐受除草剂,如草甘膦和草铵膦,其中一些按照以下商品名可以商购获得:RoundupReady®(耐草甘膦,孟山都(Monsanto),美国)、Cultivance®(耐咪唑啉酮,BASF SE,德国)和LibertyLink®(耐草铵膦,拜耳作物科学

(Bayer CropScience), 德国)。

[0245] 此外,通过使用重组DNA技术而能够合成一种或多种杀虫蛋白,尤其是那些已知的来自细菌属(芽孢杆菌)的杀虫蛋白的植物也在本发明的范围内。所述芽孢杆菌尤其是已知来自苏云金芽孢杆菌,如 δ -内毒素,例如Cry1A(b)、Cry1A(c)、Cry1F、Cry1F(a2)、Cry11A(b)、Cry111A、Cry111B(b1)或Cry9c;营养期杀虫蛋白(VIP),例如VIP1、VIP2、VIP3或VIP3A;线虫共生细菌(bacteria colonizing nematodes),例如光杆菌属(Photorhabdus spp.)或致病杆菌属(Xenorhabdus spp)的杀虫蛋白;动物产生的毒素,如蝎毒、蜘蛛毒素、黄蜂毒素或其他昆虫特有的神经毒素;真菌产生的毒素,如链霉菌毒素,植物凝集素(plant lectins),如豌豆或大麦凝集素;凝集素(agglutinins);蛋白酶抑制剂,例如胰蛋白酶抑制剂、丝氨酸蛋白酶抑制剂、马铃薯糖蛋白(patatin)、胱抑素(cystatin)或木瓜蛋白酶(papain)抑制剂;核糖体失活蛋白(RIP),例如蓖麻毒蛋白(ricin)、玉米-RIP、相思豆毒蛋白(abrin)、丝瓜籽蛋白(luffin)、肥皂草素(saporin)或异株泻根毒蛋白(bryodin);类固醇代谢酶,例如3-羟基类固醇氧化酶、蜕皮类固醇-IDP-糖基转移酶(ecdysteroid-IDP-glycosyl-transferase)、胆固醇氧化酶、蜕皮激素(ecdysone)抑制剂或HMG-CoA-还原酶;离子通道阻滞剂,例如钠或钙通道阻滞剂;保幼激素酯酶;利尿激素(diuretic hormone)受体(棉铃虫激肽(helicokinin)受体);芪合酶、联苄合酶(bibenzyl synthase)、几丁质酶或葡聚糖酶。在本发明的上下文中,这些杀虫蛋白或毒素也应被明确理解为前毒素、杂合蛋白、截短或以其他方式修饰的蛋白。杂合蛋白的特征在于蛋白质结构域的新组合,(参见,例如W002/015701)。此类毒素或能够合成此类毒素的基因修饰植物的其他实例公开于,例如EP374753、W093/007278、W095/34656、EP427529、EP451878、W003/18810和W003/52073中。生产此类基因修饰植物的方法通常是本领域技术人员已知的并且描述于例如上述出版物中。转基因植物中含有的这些杀虫蛋白赋予产生这些蛋白的植物耐受来自所有节肢动物分类群的有害害虫,尤其是甲壳虫(鞘翅目(Coleoptera))、双翅昆虫(双翅目(Diptera))和飞蛾(鳞翅目(Lepidoptera))以及耐受线虫类(nematodes)(线虫纲(Nematoda))。能够合成一种或多种杀虫蛋白的基因修饰植物记载于,例如,上述出版物中,并且其中的一些是可以商购获得的,例如YieldGard®(产生Cry1Ab毒素的玉米品种)、YieldGard®Plus(产生Cry1Ab和Cry3Bb1毒素的玉米品种)、Starlink®(产生Cry9c毒素的玉米品种)、Herculex®RW(产生Cry34Ab1、Cry35Ab1和草丁膦-N-乙酰转移酶(phosphinothricin-N-acetyltransferase)[PAT]这种酶的玉米品种);NuCOTN®33B(产生Cry1Ac毒素的棉花品种)、Bollgard®I(产生Cry1Ac毒素的棉花品种)、Bollgard®II(产生Cry1Ac和Cry2Ab2毒素的棉花品种);VIPCOT®(产生VIP毒素的棉花品种);NewLeaf®(产生Cry3A毒素的马铃薯品种);来自法国先正达种子公司的BT-Xtra®, NatureGard®, KnockOut®, BiteGard®, Protecta®, BT1 1(例如Agrisure®CB)和BT176(产生Cry1Ab毒素和PAT酶的玉米品种),来自法国先正达种子公司的MIR604(产生Cry3A毒素改良版本的玉米品种,参见W003/018810),来自比利时孟山都欧洲S.A.的MON 863(产生Cry3Bb1毒素的玉米品种),来自比利时孟山都欧洲S.A.的IPC 531(产生Cry1Ac毒素的改良版本的棉花品种)和来自比利时先锋海外公司的1507(生产Cry1 F毒素和PAT酶的玉米品种)。

[0246] 此外,通过使用重组DNA技术而能够合成一种或多种蛋白质来增加这些植物对细

菌、病毒或真菌病原体的抗性或耐受性的植物也在本发明的范围内。此类蛋白质的实例是所谓的“病程相关蛋白 (pathogenesis-related protein)” (PR蛋白, 参见, 例如EP392225)、植物抗病基因 (例如马铃薯栽培品种, 其表达源自墨西哥野生马铃薯 *Solanum bulbocastanum* 的抗致病疫霉 (*Phytophthora infestans*) 的抗性基因) 或T4-溶菌酶 (例如能够合成这些蛋白质的马铃薯栽培品种对如梨火疫病菌 (*Erwinia amylovora*) 的细菌具有提高的抵抗力)。生产此类基因修饰植物的方法通常是本领域技术人员已知的并且描述于例如上述出版物中。

[0247] 此外, 通过使用重组DNA技术而能够合成一种或多种蛋白质以提高生产率 (例如生物物质产量、谷粒产量、淀粉含量、油含量或蛋白质含量)、耐旱、盐或其他限制生长的环境因素或对这些植物的害虫和真菌、细菌或病毒病原体的耐受性的植物也在本发明的范围内。

[0248] 此外, 通过使用重组DNA技术含有修改量的物质含量或新物质含量以改善人类或动物营养的植物, 例如产生促进健康的长链omega-3脂肪酸或不饱和omega-9脂肪酸的油料作物 (例如Nexera®油菜, DOW Agro Sciences, 加拿大), 也在本发明的范围内。

[0249] 此外, 通过使用重组DNA技术含有修改量的物质含量或新物质含量以提高原材料生产的植物, 例如产生更多支链淀粉的马铃薯 (例如Amflora®马铃薯、巴斯夫SE, 德国), 也在本发明的范围内。

[0250] 本发明还涉及一种控制或预防植物病原微生物在农作物和/或园艺作物中侵染植物的方法, 其中将有效量的至少一种本发明的通式I化合物或组合, 或本发明的组合物施用于植物种子。本发明的化合物、组合和组合物可用于控制或预防植物病害。通式I化合物、其组合和/或组合物分别特别适用于防治以下植物病害:

[0251] 观赏植物、蔬菜 (例如白锈菌 (*A. Candida*)) 和向日葵 (例如婆罗门参白锈菌 (*A. tragopogonis*)) 上的白锈菌属 (*Albugo* spp.) (白锈病); 蔬菜、油菜 (芸苔生链格孢 (*A. brassicola*) 或芸苔链格孢 (*brassicae*))、糖用甜菜 (细链格孢 (*A. tenuis*))、水果、稻、大豆、马铃薯 (例如茄链格孢 (*A. solani*) 或互隔链格孢菌 (*A. alternata*))、番茄 (例如茄链格孢或互隔链格孢菌) 和小麦上的链格孢属 (*Alternaria* spp.) (链格孢叶斑病); 糖用甜菜和蔬菜上的丝囊霉属 (*Aphanomyces* spp.); 禾谷类和蔬菜上的壳二孢属 (*Ascochyta* spp.), 例如小麦上的小麦壳二孢 (*A. tritici*) (炭疽病) 和大麦上的大麦壳二孢 (*A. hordei*); 平脐蠕孢属 (*Bipolaris* spp.) 和内脐蠕孢属 (*Drechslera* spp.) (有性态: 旋孢腔菌属 (*Cochliobolus* spp.)), 例如玉米上的小斑病 (Southern leaf blight) (玉蜀黍平脐蠕孢 (*D. maydis*) 或大斑病 (Northern leaf blight) 玉米生平脐蠕孢 (*B. zeicola*)), 例如禾谷类上的斑枯病 (spot blotch) (麦根腐平脐蠕孢 (*C. sorokiniana*)) 以及例如稻和草坪上的稻平脐蠕孢 (*B. oryzae*); 禾谷类 (例如小麦或大麦) 上的小麦白粉菌 (*Blumeria* (旧名: *Erysiphe*) *graminis*) (白粉病); 水果和浆果 (例如草莓)、蔬菜 (例如莴苣、胡萝卜、芹菜 (*celery*) 和甘蓝)、油菜、花卉、葡萄藤、森林植物和小麦上的灰葡萄孢 (*Botrytis cinerea*) (有性态: 富氏葡萄孢盘菌 (*Botryotinia fuckeliana*)): 灰霉病); 莴苣上的莴苣盘梗霉 (*Bremia lactucae*) (霜霉病); 阔叶树和常青树上的长喙壳属 (*Ceratocystis*) (同义词: 线喙壳属 (*Ophiostoma*)) (腐烂病或枯萎病), 例如榆树上的榆长喙壳 (*C. ulmi*) (荷兰榆病); 玉米 (例如灰叶斑病: 玉米尾孢菌 (*C. zea-maydis*))、稻、糖用甜菜 (例如甜菜生尾孢 (*C. beticola*))、甘蔗、蔬菜、咖啡、大豆 (例如大豆灰斑病菌 (*C. sojina*) 或大豆紫斑病菌

(*C.kikuchii*)和稻上的尾孢属(*Cercospora* spp.) (尾孢叶斑病);番茄(例如番茄叶霉菌(*C.fulvum*):叶霉病)和禾谷类(例如小麦上的多主枝孢(*C.herbarum*) (黑穗病(black ear)))上的枝孢属(*Cladosporium* spp.);禾谷类上的麦角菌(*Claviceps purpurea*) (麦角病);玉米(炭色旋孢腔菌(*C.carbonum*))、禾谷类(例如禾旋孢腔菌(*C.sativus*),无性态:麦根腐平脐蠕孢(*B.sorokiniana*))和稻(例如宫部旋孢腔菌(*C.miyabeanus*),无性态:稻长蠕孢(*H.oryzae*))上的旋孢腔菌属(*Cochliobolus*) (无性态:长蠕孢属(*Helminthosporium*)或平脐蠕孢属) (叶斑病);棉花(例如棉炭疽病菌(*C.gossypii*))、玉米(例如禾生炭疽病菌(*C.graminicola*):炭疽茎腐病)、软果、马铃薯(例如马铃薯炭疽病菌(*C.coccodes*):黑点病)、菜豆(例如菜豆炭疽病菌(*C.lindemuthianum*))和大豆(例如大豆炭疽病菌(*C.truncatum*)或胶孢炭疽病菌(*C.gloeosporioides*))上的刺盘孢属(*Colletotrichum* spp.) (有性态:围小丛壳菌属(*Glomerella*)) (炭疽病);伏革菌属(*Corticium* spp.),例如稻上的笹木伏革菌(*C.sasakii*) (纹枯病);大豆和观赏植物上的多主棒孢(*Corynespora cassiicola*) (叶斑病);锈斑病菌属(*Cycloconium* spp.),例如橄榄树上的油橄榄孔雀斑病菌(*C.oleaginum*);果树、葡萄藤(例如*C.liriodendri*,有性态:*Neonectria liriodendri*:乌脚病)和观赏树上的柱孢属(*Cylindrocarpon* spp.) (例如果树腐烂病或幼藤衰退,有性态:丛赤壳属(*Nectria* spp.)或新丛赤壳属(*Neonectria* spp.));大豆上的白纹羽菌(*Dematophora* (有性态:*Rosellinia necatrix*)) (根腐病和茎腐病);间座壳属(*Diaporthe* spp.),例如大豆上的大豆北茎溃疡病菌(*D.phaseolorum*) (立枯病);玉米、禾谷类如大麦(例如大麦网斑内脐蠕孢(*D.teres*),网斑病)和小麦(例如*D.tritici-repentis*:褐斑病)、稻和草坪上的内脐蠕孢属(同义词长蠕孢属,有性态:核腔菌属(*Pyrenophora*));由层卧孔菌(*Formitiporia punctata* (同义词*Phellinus punctata*))、*F.mediterranea*、*Phaeoconiella chlamydospora* (旧名为*Phaeoacremonium chlamydosporum*)、*Phaeoacremonium aleophilum*和/或*Botryosphaeria obtusa*引起的葡萄藤上的埃斯卡(*Esca*) (顶梢枯死,干枯病(*apoplexy*));仁果(梨痂囊腔菌(*E.pyri*))、软果(覆盆子痂囊腔菌(*E.veneta*):炭疽病)和葡萄藤(葡萄痂囊腔菌(*E.ampelina*):炭疽病)上的痂囊腔菌属(*Elsinoe* spp.);稻上的稻叶黑粉菌(*Entyloma oryzae*) (叶黑粉病);小麦上的附球菌属(*Epicoccum* spp.) (黑霉病);糖用甜菜(甜菜白粉菌(*E.betae*))、蔬菜(例如豌豆白粉菌(*E.pisi*))、如葫芦科植物(例如菊科白粉菌(*E.cichoracearum*))、甘蓝、油菜(例如十字花科白粉菌(*E.cruciferarum*))上的白粉菌属(*Erysiphe* spp.) (白粉病);果树、葡萄藤和观赏树上的侧弯孢菌(*Eutypa lata*) (*Eutypa*溃疡病或枯萎病,无性态:*Cytosporina lata*,同义词*Libertella blepharis*);玉米(例如玉米大斑病菌(*E.turcicum*))上的突脐蠕孢属(*Exserohilum* spp.) (同义词长蠕孢属);各种植物上的镰孢霉属(*Fusarium* spp.) (有性态:赤霉属(*Gibberella* spp.)) (枯萎病,根腐病或茎腐病),例如禾谷类(例如小麦或大麦)上的禾谷镰孢(*F.graminearum*)或大刀镰孢(*F.culmorum*) (根腐病、疮痂病(*scab*)或赤霉病(*head blight*)),番茄上的尖孢镰孢(*F.oxysporum*),大豆上各自引起突然死亡综合症的腐皮镰孢(*F.solani*) (现在的*f.sp.glycines*,同义词为北美大豆猝死综合症病菌(*F.virguliforme*)及南美大豆猝死综合症病菌(*F.tucumaniae*)和巴西镰刀菌(*F.brasiliense*)以及玉米上的轮枝镰孢(*F.verticillioides*);禾谷类(例如小麦或大麦)和玉米上的禾顶囊壳(*Gaeumannomyces graminis*) (全蚀病(*take-all*));禾谷类(例如玉蜀

黍赤霉 (*G. zeae*) 和稻 (例如藤仓赤霉 (*G. fujikuroi*): 恶苗病) 上的赤霉属 (*Gibberella* spp.); 葡萄藤、仁果和其他植物上的围小丛壳菌 (*Glomerella cingulata*) 以及棉花上的棉炭疽病菌 (*G. gossypii*); 稻上的谷粒染色复合物 (Grainstaining complex); 葡萄藤上的葡萄黑腐病菌 (*Guignardia bidwellii*) (黑腐病); 蔷薇科植物和桧属植物上的锈菌属 (*Gymnosporangium* spp.), 例如梨上的梨锈菌 (*G. sabinae*) (锈病); 玉米、禾谷类和稻上的长蠕孢属 (同义词内脐蠕孢属 (*Drechslera*), 有性态: 旋孢腔菌属); 驼孢锈菌属 (*Hemileia* spp.), 例如咖啡上的咖啡驼孢锈菌 (*H. vastatrix*) (咖啡叶锈病); 葡萄藤上的褐斑拟棒束孢 (*Isariopsis clavispora*) (同义词 *Cladosporium vitis*); 大豆和棉花上的菜豆壳球孢 (*Macrophomina phaseolina* (同义词 *phaseoli*)) (根腐病和茎腐病); 禾谷类 (例如小麦或大麦) 上的雪霉叶枯菌 (*Microdochium* (同义词 *Fusarium*) *nivale*) (雪霉病); 大豆上的扩散叉丝壳 (*Microsphaera diffusa*) (白粉病); 链核盘菌属 (*Monilinia* spp.), 例如核果和其他蔷薇科植物上的核果链核盘菌 (*M. laxa*)、美澳型核果褐腐病菌 (*M. fructicola*) 和果生链核盘菌 (*M. fructigena*) (花腐病和枝腐病, 褐腐病); 禾谷类、香蕉、软果和花生上的球腔菌属 (*Mycosphaerella* spp.), 例如小麦上的禾生球腔菌 (*M. graminicola*) (无性态: 小麦壳针孢 (*Septoria tritici*), 壳针孢叶斑病 (*Septoria blotch*)) 或香蕉上的斐济球腔菌 (*M. fijiensis*) (黑香蕉叶斑病 (black Sigatoka disease)); 甘蓝 (例如芸苔霜霉 (*P. brassicae*))、油菜 (例如寄生霜霉 (*P. parasitica*))、洋葱 (例如大葱霜霉 (*P. destructor*))、烟草 (烟草霜霉 (*P. tabacina*)) 和大豆 (例如大豆霜霉病菌 (*P. manshurica*)) 上的霜霉属 (*Peronospora* spp.) (霜霉病); 大豆上的豆薯层锈菌 (*Phakopsora pachyrhizi*) 和山马蟥层锈菌 (*P. Meibomiae*) (大豆锈病); 例如葡萄藤 (例如 *P. tracheiphila* 和 *P. tetraspora*) 和大豆 (例如大豆茎褐腐病菌 (*P. gregata*): 茎腐病) 上的瓶霉菌属 (*Phialophora* spp.); 油菜和甘蓝上的黑胫茎点霉 (*Phoma lingam*) (根腐病和茎腐病) 以及糖用甜菜上的甜菜茎点霉 (*P. betae*) (根腐病、叶斑病和立枯病 (damping-off)); 向日葵、葡萄藤 (例如葡萄拟茎点霉 (*P. viticola*): 蔓割病 (can rot) 和叶斑病) 和大豆 (例如茎腐病: *P. phaseoli*, 有性态: 大豆北茎溃疡病菌 (*Diaporthe phaseolorum*)) 上的拟茎点霉属 (*Phomopsis* spp.); 玉米上的玉蜀黍节壶菌 (*Physoderma maydis*) (褐斑病); 各种植物如辣椒和葫芦科植物 (例如辣椒疫霉 (*P. capsici*))、大豆 (例如大雄疫霉 (*P. megasperma*), 同义词大豆疫霉 (*P. sojae*))、大豆、马铃薯和番茄 (例如致病疫霉 (*P. infestans*): 晚疫病 (late blight)) 和阔叶树 (例如栎树猝死病菌 (*P. ramorum*): 橡树猝死病) 上的疫霉属 (*Phytophthora* spp.) (枯萎病, 根腐病, 叶腐病, 果腐病和茎腐病); 甘蓝、油菜、萝卜 (radish) 和其他植物上的芸苔根肿菌 (*Plasmodiophora brassicae*) (根肿病); 轴霜霉属 (*Plasmopara* spp.), 例如葡萄藤上的葡萄生单轴霉 (*P. viticola*) (葡萄藤霜霉病) 和向日葵上的霍尔斯单轴霉 (*P. halstedii*); 蔷薇科植物、啤酒花、仁果和软果上的叉丝单囊壳属 (*Podosphaera* spp.) (白粉病), 例如苹果上的白叉丝单囊壳 (*P. leucotricha*); 例如禾谷类如大麦和小麦 (禾谷多粘菌 (*P. graminis*)) 以及糖用甜菜 (甜菜多粘菌 (*P. betae*)) 上的多粘菌属 (*Polymyxa* spp.) 以及由此传播的病毒病害; 禾谷类如小麦或大麦上的小麦基腐病菌 (*Pseudocercospora herpotrichoides*) (眼斑病, 有性态: *Tapesia yallundae*); 各种植物上的假霜霉属 (*Pseudoperonospora*) (霜霉病), 例如葫芦科植物上的古巴假霜霉 (*P. cubensis*) 或啤酒花上的葎草假霜 (*P. humili*); 葡萄藤上的葡萄角斑叶焦病菌

(*Pseudopezizicola tracheiphila*) (红火病 (red fire disease) 或 'rotbrenner', 无性态: 瓶霉属 (*Phialophora*)); 各种植物上的柄锈菌属 (*Puccinia* spp.) (锈病), 例如禾谷类如小麦、大麦或黑麦上的小麦叶锈菌 (*P. tritricina*) (褐锈病或叶锈病), 条形柄锈菌 (*P. striiformis*) (条纹病或黄锈病), 大麦柄锈菌 (*P. hordei*) (矮锈病 (dwarf rust)), 禾柄锈菌 (*P. graminis*) (茎腐病或黑锈病) 或隐匿柄锈菌 (*P. recondita*) (褐锈病或叶锈病), 甘蔗上的屈恩柄锈菌 (*P. kuehni*) (黄锈病) 和芦笋上的天门冬属柄锈病 (*P. asparagi*); 小麦上的偃麦草核腔菌 (*Pyrenophora* (无性态: 内脐蠕孢属 (*Drechslera*)) *tritici-repentis*) (黄斑病 (tan spot)) 或大麦上的圆核腔菌 (*P. teres*) (网斑病 (net blotch)); 梨孢属 (*Pyricularia* spp.), 例如稻上的稻梨孢 (*P. oryzae*) (有性态: 灰色小盘二孢 (*Magnaporthe grisea*), 稻瘟病) 以及草坪和禾谷类上的灰梨孢 (*P. grisea*); 草坪、稻、玉米、小麦、棉花、油菜、向日葵、大豆、糖用甜菜、蔬菜和各种其他植物 (例如终极腐霉菌 (*P. ultimum*) 或瓜果腐霉菌 (*P. aphanidermatum*)) 上的腐霉属 (*Pythium* spp.) (立枯病); 柱隔孢属 (*Ramularia* spp.), 例如大麦上的大麦柱隔孢叶斑病菌 (*R. collo-cygni*) (柱隔孢叶斑病, 生理叶斑病) 和糖用甜菜上的甜菜生柱隔孢 (*R. beticola*); 棉花、稻、马铃薯、草坪、玉米、油菜、马铃薯、糖用甜菜、蔬菜和各种其他植物上的丝核菌属 (*Rhizoctonia* spp.), 例如大豆上的立枯丝核菌 (*R. solani*) (根腐病/茎腐病), 稻上的立枯丝核菌 (纹枯病) 或小麦或大麦上的禾谷丝核菌 (*R. cerealis*) (丝核菌春枯病 (*Rhizoctonia* spring blight)); 草莓、胡萝卜、甘蓝、葡萄藤和番茄上的葡枝根霉 (*Rhizopus stolonifer*) (黑霉病, 软腐病); 大麦、黑麦和黑小麦上的黑麦喙孢 (*Rhynchosporium secalis*) (云纹病 (scald)); 稻上的稻帚枝霉 (*Sarocladium oryzae*) 和 *S. attenuatum* (叶鞘腐败病 (sheath rot)); 蔬菜和大田作物如油菜、向日葵 (例如核盘菌 (*S. sclerotiorum*)) 和大豆 (例如齐整小核盘菌 (*S. rolfisii*) 或核盘菌) 上的核盘菌属 (*Sclerotinia* spp.) (茎腐病或白绢病); 各种植物上的壳针孢属 (*Septoria* spp.), 例如大豆上的大豆壳针孢 (*S. glycines*) (褐斑病), 小麦上的小麦壳针孢 (*S. tritici*) (壳针孢斑纹病 (*Septoria* blotch)) 和禾谷类上的颖枯壳针孢 (*S.* (同义词壳多孢 (*Stagonospora*)) *nodorum*) (壳多孢斑纹病 (*Stagonospora* blotch)); 葡萄藤上的葡萄钩丝壳 (*Uncinula* (同义词白粉菌 (*Erysiphe*)) *necator*) (白粉病, 无性态: 葡萄粉孢 (*Oidium tuckeri*)); 玉米 (例如玉米大斑病菌 (*S. turcicum*), 同义词大斑凸脐蠕孢 (*Helminthosporium turcicum*)) 和草坪上的毛球腔菌属 (*Setosphaeria* spp.) (叶枯病); 玉米 (例如丝轴黑粉菌 (*S. reiliana*): 丝黑穗病)、高粱和甘蔗上的轴黑粉菌属 (*Sphaerellotheca* spp.) (黑穗病); 葫芦科植物上的单丝壳白粉菌 (*Sphaerotheca fuliginea*) (白粉病); 马铃薯上的粉痂菌 (*Spongospora subterranea*) (粉痂病) 以及由此传播的病毒病害; 禾谷类上的壳多孢属 (*Stagonospora* spp.), 例如小麦上的颖枯壳多孢 (*S. nodorum*) (斑枯病 (*Stagonospora* blotch), 有性态: 颖枯小球腔菌 (*Leptosphaeria* [同义词 *Phaeosphaeria*] *nodorum*)); 马铃薯上的内生集壶菌 (*Synchytrium endobioticum*) (马铃薯癌肿病); 外囊菌属 (*Taphrina* spp.), 例如桃上的畸形外囊菌 (*T. deformans*) (曲叶病) 和李上的李外囊菌 (*T. pruni*) (李囊果病 (plum pocket)); 烟草、仁果、蔬菜、大豆和棉花上的根串珠霉属 (*Thielaviopsis* spp.) (黑根腐病), 例如根串珠霉 (*T. basicola*) (同义词雅致鞘孢 (*Chalara elegans*)); 禾谷类上的腥黑粉菌属 (*Tilletia* spp.) (腥黑穗病 (common bunt) 或光腥黑穗病 (stinking smut)), 例如小麦上的小麦网腥黑粉菌 (*T. tritici*) (同义

词*T.caries*,小麦腥黑穗病)和小麦矮腥黑穗病菌(*T.controversa*) (矮腥黑穗病);大麦或小麦上的肉孢核瑚菌(*Typhula incarnata*) (灰雪腐病);条黑粉菌属(*Urocystis* spp.),例如黑麦上的隐条黑粉菌(*U.occulta*) (杆黑粉病);蔬菜如菜豆(例如疣顶单胞锈菌(*U.appendiculatus*),同义词菜豆单胞锈菌(*U.phaseoli*))和糖用甜菜(例如甜菜锈病菌(*U.betae*))上的单胞锈菌属(*Uromyces* spp.) (锈病);禾谷类(例如大麦散黑粉菌(*U.nuda*)和燕麦散黑粉菌(*U.avaenae*))、玉米(例如玉蜀黍黑粉菌(*U.maydis*):玉米黑穗病)和甘蔗上的黑粉菌属(*Ustilago* spp.) (黑穗病);苹果(例如苹果黑星菌(*V.inaequalis*))和梨上的黑星菌属(*Venturia* spp.) (黑星病);以及各种植物如,果树和观赏树、葡萄藤、软果、蔬菜和大田作物上的轮枝孢属(*Verticillium* spp.) (枯萎病),例如草莓、油菜、马铃薯和番茄上的大丽花轮枝孢(*V.dahliae*)。

[0252] 通式I化合物、其组合或组合物可用于治疗多种真菌病原体。可根据本发明治疗的真菌疾病病原体的非限制性实例包括:

[0253] 黑粉菌目(*Ustilaginales*),例如稻绿核菌(*Ustilaginoidea virens*)、大麦散黑粉菌(*Ustilago nuda*)、小麦散黑粉菌(*Ustilago tritici*)、玉米黑粉菌(*Ustilago zeae*),例如由柄锈菌目(*Pucciniales*)引起的那些锈病,例如无花果蜡锈菌(*Cerotelium fici*)、云杉帚金锈菌(*Chrysomyxa arctostaphyli*)、甘薯鞘锈菌(*Coleosporium ipomoeae*)、咖啡驼孢锈菌(*Hemileia vastatrix*)、落花生柄锈菌(*Puccinia arachidis*)、cacabata柄锈菌(*Puccinia cacabata*)、禾柄锈菌(*Puccinia graminis*)、隐匿柄锈菌(*Puccinia recondita*)、高粱柄锈菌(*Puccinia sorghi*)、大麦柄锈菌(*Puccinia hordei*)、大麦条形柄锈菌(*Puccinia striiformis* f.sp.Hordei)、黑麦条形柄锈菌(*Puccinia striiformis* f.sp.Secalis)、榛膨痂锈菌(*Pucciniastrum coryli*),或锈菌目(*Uredinales*),例如茶隰生柱锈菌(*Cronartium ribicola*)、juniperi-viginiana胶锈菌(*Gymnosporangium juniperi-viginiana*)、美洲栅锈菌(*Melampsora medusae*)、豆薯层锈菌(*Phakopsora pachyrhizi*)、短尖多胞锈菌(*Phragmidium mucronatum*)、白藜壳锈菌(*Physopella ampeloidis*)、异色疣双胞锈菌(*Tranzschelia discolor*)和蚕豆单胞锈菌(*Uromyces viciae-fabae*);和其他腐烂和疾病,例如由隐球酵母属(*Cryptococcus* spp.)、坏损外担菌(*Exobasidium vexans*)、inoderma微皮伞(*Marasmiellus inoderma*)、小菇属(*Mycena* spp.)、丝轴黑粉菌(*Sphacelotheca reiliana*)、斑叶兰核瑚菌(*Typhula ishikariensis*)、冰草条黑粉菌(*Urocystis agropyri*)、ltersonilia perplexans、invisum伏草菌(*Corticium invisum*)、Laetisaria fuciformis、Waitea circinata、立枯丝核菌(*Rhizoctonia solani*)、Thanetophorus cucurmeris、大丽花叶黑粉菌(*Entyloma dahliae*)、小孢叶黑粉菌(*Entylomella microspora*)、麦氏草尾孢黑粉菌(*Neovossia moliniae*)和小麦网腥黑粉菌(*Tilletia caries*)引起的那些。芽枝霉纲(*Blastocladiomycetes*),如玉蜀黍节壶菌(*Physoderma maydis*);毛霉纲(*Mucoromycetes*),例如瓜笋霉(*Choanephora cucurbitarum*);毛霉菌属(*Mucor* spp.);和少根根霉(*Rhizopus arrhizus*),

[0254] 在另一个实施方式中,由锈病病原体引起的疾病,例如胶锈菌种,例如sabinae胶锈菌(*Gymnosporangium sabinae*);驼孢锈菌种,例如咖啡驼孢锈菌(*Hemileia vastatrix*);层锈菌种,例如豆薯层锈菌(*Phakopsora pachyrhizi*)或山马蟥层锈菌

(*Phakopsora Meibomiae*);柄锈菌种,例如隐匿柄锈菌(*Puccinia recondita*)、禾柄锈菌(*Puccinia graminis*)或条形柄锈病(*Puccinia striiformis*);单孢锈菌种,例如疣顶单孢锈菌(*Uromyces appendiculatus*);

[0255] 特别是,茶藨生柱锈菌(*Cronartium ribicola*) (白松疱锈病);*juniperi-virginianae*胶锈菌(*Gymnosporangium juniperi-virginianae*) (雪松苹果锈病);咖啡驼孢锈菌(*Hemileia vastatrix*) (咖啡锈病);山马蠹层锈菌(*Phakopsora meibomiae*)和豆薯层锈菌(*P.pachyrhizi*) (大豆锈病);禾冠柄锈菌(*Puccinia coronata*) (燕麦和黑麦草的冠锈病);禾柄锈菌(*Puccinia graminis*) (小麦和肯塔基兰草的茎锈病,或和禾谷类的黑锈病);萱草柄锈菌(*Puccinia hemerocallidis*) (黄花菜锈病);小麦固柄锈菌亚种(*Puccinia persistens subsp.triticina*) (小麦锈病或‘褐或赤锈病’);高粱柄锈菌(*Puccinia sorghi*) (玉米锈病);条形柄锈菌(*Puccinia striiformis*) (禾谷类中的‘黄锈病’);疣顶单孢锈菌(*Uromyces appendiculatus*) (豆锈病);菜豆单孢锈菌(*Uromyces phaseoli*) (豆锈病);黑顶柄锈菌(*Puccinia melanocephala*) (甘蔗中的‘褐锈病’);屈恩柄锈菌(*Puccinia kuehnii*) (甘蔗中的‘橙锈病’)。

[0256] 可根据本发明处理的植物包括:棉花、亚麻、葡萄、水果、蔬菜,例如蔷薇科(*Rosaceae sp*) (例如仁果类,例如苹果、梨、杏、樱桃、扁桃和桃)、*Ribesioideae sp.*、胡桃科(*Juglandaceae sp.*)、桦木科(*Betulaceae sp.*)、漆树科(*Anacardiaceae sp.*)、壳斗科(*Fagaceae sp.*)、桑科(*Moraceae sp.*)、木犀科(*Oleaceae sp.*)、猕猴桃科(*Actinidaceae sp.*)、樟科(*Lauraceae sp.*)、芭蕉科(*Musaceae sp.*) (例如香蕉树和种植园)、茜草科(*Rubiaceae sp.*) (例如咖啡)、山茶科(*Theaceae sp.*)、梧桐科(*Sterculiaceae sp.*)、芸香科(*Rutaceae sp.*) (例如柠檬、橙和葡萄柚);葡萄科(*Vitaceae sp.*) (例如葡萄);茄科(*Solanaceae sp.*) (例如西红柿、辣椒)、百合科(*Liliaceae sp.*)、菊科(*Asteraceae sp.*) (例如莴苣)、伞形科(*Umbelliferae sp.*)、十字花科(*Cruciferae sp.*)、藜科(*Chenopodiaceae sp.*)、葫芦科(*Cucurbitaceae sp.*) (例如黄瓜)、葱科(*Alliaceae sp.*) (例如韭菜、洋葱)、蝶形花科(*Papilionaceae sp.*) (例如豌豆);主要农作物,如禾本科(*Poaceae/Gramineae sp.*) (例如玉米、草皮、和禾谷类,如小麦、黑麦、稻、大麦、燕麦、小米和黑小麦)、菊科(*Asteraceae sp.*) (例如向日葵),十字花科(*Brassicaceae sp.*) (例如白球甘蓝、紫甘蓝、西兰花、花椰菜、抱子甘蓝、白菜、大头菜、萝卜和油菜、芥菜、辣根和水芹),豆科(*Fabaceae sp.*) (例如豆类、花生),蝶形花科(*Papilionaceae sp.*) (例如大豆),茄科(*Solanaceae sp.*) (例如马铃薯),藜科(*Chenopodiaceae sp.*) (例如糖用甜菜、饲料甜菜、瑞士甜菜、甜菜根);锦葵科(*Malvaceae*) (例如棉花);用于花园和林区的有用植物和观赏植物;以及这些植物中每种转基因品种。

[0257] 更优选控制以下大豆病害:例如由格链孢霉叶斑病(*Altemaria leaf spot*) (*Altemaria spec.atrans tenuissima*)、炭疽病(*Anthracoise*) (*Colletotrichum gloeosporoides dematium var.truncatum*)、褐斑病(*brown spot*) (大豆壳针孢(*Septoria glycines*))、尾孢叶斑病和叶枯病(*cercospora leaf spot and blight*) (菊池尾孢(*Cercospora kikuchii*))、笄霉属叶枯病(*choanephora leaf blight*) (*Choanephora infundibulifera trispora* (同义词))、*dactuliophora*叶斑病(*Dactuliophora glycines*)、霜霉病(东北霜霉(*Peronospora manshurica*))、德氏霉属枯萎病(*Drechslera*

glycini)、蛙眼叶斑病((大豆花孢(*Cercospora sojae*))、小光亮属叶斑病(*leptosphaerulina leaf spot*) (车轴草小光亮(*Leptosphaerulina trifolii*))、叶点霉属叶斑病(*phyllosticta leaf spot*) (大豆生叶点霉(*Phyllosticta sojaecola*))、豆荚和茎枯病(拟茎点霉(*Phomopsis sojae*))、白粉病(扩散叉丝壳(*Microsphaera diffusa*))、棘壳孢属叶斑病(大豆棘壳孢(*Pyrenochaeta glycines*))、丝核菌属地上部分、叶子和网枯病(立枯丝核菌(*Rhizoctonia solani*))、锈病(豆薯层锈菌、山马螬层锈菌)、疮痂病(大豆痂圆孢(*Sphaceloma glycines*))、葡柄霉叶枯病(葡柄霉(*Stemphylium botryosum*))、靶斑病((山扁豆生棒孢(*Corynespora cassiicola*))引起的叶、茎、豆荚和种子上的真菌病害。

[0258] 例如由黑根腐病(野百合丽赤壳(*Calonectria crotalariae*))、炭腐病(菜豆壳孢(*Macrophomina phaseolina*))、镰刀菌枯萎病(blight或wilt)、根腐病和豆荚和茎腐烂病(尖镰孢(*Fusarium oxysporum*))、直喙镰孢(*Fusarium orthoceras*)、半裸镰孢(*Fusarium semitectum*)、木贼镰孢(*Fusarium equiseti*))、黑盘孢属(*mycoleptodiscus*)根腐病(*Mycoleptodiscus terrestris*)、新赤壳属(*neocosmospora*) (侵菅新赤壳(*Neocosmospora vasinfecta*))、豆荚和茎枯病(菜豆间座壳(*Diaporthe phaseolorum*))、茎溃疡病((菜豆间座壳大豆变种(*Diaporthe phaseolorum var. caulivora*))、疫霉属腐病(大雄疫霉(*Phytophthora megasperma*))、茎褐腐病((大豆茎褐腐病菌(*Phialophora gregata*))、腐霉属腐烂病(瓜果腐霉(*Pythium aphanidennatum*)、畸雌腐霉(*Pythium irregulare*)、德巴利腐霉(*Pythium debaryanum*)、群结腐霉(*Pythium myriotylum*)、终极腐霉(*Pythium ultimum*))、丝核菌属根腐病、茎腐病和猝倒病(立枯丝核菌(*Rhizoctonia solani*))、核盘菌属茎腐病(核盘菌(*Sclerotinia sclerotiorum*))、核盘菌属南方枯萎病(齐整核盘菌(*Sclerotinia rolfisii*))、根串珠霉属根腐病(根串珠霉(*Thielaviopsis basicola*))引起的根和茎基部的真菌病害。

[0259] 本发明还涉及通式I的化合物、其组合或组合物用于防治或预防以下植物病害的用途:各种植物上的柄锈菌属(*Puccinia spp.*) (锈病),例如但不限于在禾谷类(诸如,例如小麦、大麦或黑麦)上的小麦柄锈菌(*P. trititica*) (褐锈病或叶锈病)、条形柄锈病(*P. striiformis*) (条锈病或黄锈病)、大麦柄锈病(*P. hordei*) (矮锈病)、禾柄锈菌(*P. graminis*) (茎锈病或黑锈病)或隐匿柄锈菌(*P. recondita*) (褐锈病或叶锈病),以及在各种植物上的层锈菌属(*Phakopsoraceae spp.*),特别是大豆上的豆薯层锈菌(*Phakopsora pachyrhizi*) 和山马螬层锈菌(*P. meibomiae*) (大豆锈菌),咖啡驼孢锈菌(*Hemileia vastatrix*) (咖啡锈病),疣顶单胞锈菌(*Uromyces appendiculatus*),蚕豆单胞锈菌(*Uromyces fabae*) 和菜豆单胞锈菌(*Uromyces phaseoli*) (豆锈病)。

[0260] 本发明进一步涉及通式I化合物、其组合或组合物用于控制或预防农作物和/或园艺作物的植物病原真菌(例如豆薯层锈菌(*Phakopsora pachyrhizi*)、山马螬层锈菌(*Phakopsora meibomiae*))的用途。

[0261] 通式(I)的化合物、其组合和组合物也分别适用于在储存的产品或收获物的保护中和在材料的保护中防治有害真菌。术语“材料保护”应理解为表示保护技术和非活体材料,如粘合剂、胶、木材、纸张和纸板、纺织品、皮革、涂料分散体、塑料、冷却润滑剂、纤维或织物以防有害微生物如真菌和细菌侵袭和破坏。

[0262] 对于木材和其他材料的保护,特别应注意下列有害真菌:子囊菌纲真菌,例如线嘴

壳属 (*Ophiostoma* spp.), 长喙壳属 (*Ceratocystis* spp.), 出芽短梗霉 (*Aureobasidium pullulans*), *Sclerophoma* 属 (*Sclerophoma* spp.), 毛壳属 (*Chaetomium* spp.), 腐质霉属 (*Humicola* spp.), 彼得壳属 (*Petriella* spp.), 毛束霉属 (*Trichurus* spp.); 担子菌纲 (*Basidiomycetes*), 例如粉孢革菌属 (*Coniophora* spp.), 革盖菌属 (*Coriolus* spp.), 粘褶菌属 (*Gloeophyllum* spp.), 香菇属 (*Lentinus* spp.), 侧耳属 (*Pleurotus* spp.), 卧孔属 (*Poria* spp.), 干朽菌属 (*Serpula* spp.) 和干酪菌属 (*Tyromyces* spp.), 半知菌纲 (*Deuteromycetes*), 例如曲霉属 (*Aspergillus* spp.), 枝孢属 (*Cladosporium* spp.), 青霉属 (*Penicillium* spp.), 木霉属 (*Trichoderma* spp.), 链格孢属 (*Altemaria* spp.), 拟青霉属 (*Paecilomyces* spp.), 以及接合菌纲 (*Zygomycetes*), 例如放射毛霉属 (*Mucor* spp.), 此外在储存产品和收获物的保护中应注意下列酵母真菌: 假丝酵母属 (*Candida* spp.) 和酿酒酵母 (*Saccharomyces cerevisiae*)。

[0263] 在一个实施方式中, 式 (I) 化合物、其组合和组合物分别尤其适合于防治以下植物病害: 大豆上的豆薯层锈菌以及山马蟥层锈菌 (大豆锈病)。

[0264] 本发明进一步涉及控制或预防植物病原真菌的方法。该方法包括用有效量的至少一种式 (I) 化合物或包含至少一种式 (I) 化合物的组合或组合物处理真菌或要防止真菌侵袭的材料、植物、植物部分、其场所、土壤或种子。

[0265] 根据本发明的处理方法还可以用于保护储存产品或收获物以防真菌和微生物侵袭的领域中。根据本发明, 术语“储存产品”应理解为表示植物或动物来源的天然物质及其加工形式, 它们取自自然生命周期且对其需要长期保护。农作物来源的储存产品如植物或其部分, 例如茎、叶、块茎、种子、果实或谷粒可以以新鲜收获状态或以加工形式保护, 如经预干燥、润湿、粉碎、研磨、压榨或烘焙的, 该方法也已知为收获后处理。木料也落入储存产品的定义中, 无论是未加工木料形式, 如建筑木料、电力塔和栅栏, 还是成品形式, 如木制家具或物品。动物来源的储存产品是生皮、皮革、毛皮、毛发等。根据本发明的组合可以防止不利的效果如腐败、变色或霉变。优选“储存产品”应理解为表示植物来源的天然物质及其加工形式, 更优选果实及其加工形式, 如仁果、核果、软果和柑橘类水果及其加工形式。

[0266] 式 (I) 化合物、其组合和组合物分别可以用于改善植物健康。本发明还涉及一种通过分别用有效量的式 (I) 化合物及其组合物处理植物、其繁殖材料和/或植物生长或将要生长的场所而改善植物健康的方法。

[0267] 术语“植物健康”应理解为表示植物和/或其产品的状况, 该状况由几个指标单独或相互组合确定, 如产量 (例如增加的生物量和/或增加的有价值成分含量)、植物活力 (例如改善的植物生长和/或更绿的叶子 (“绿化效应”))、质量 (例如某些成分的含量或组成改善) 和对非生物和/或生物胁迫的耐受性。上述确定的植物健康状况的指标可以相互依存或可以相互影响。

[0268] 式 (I) 化合物可以以其生物学活性可能不同的不同晶体变体或多晶型物存在。它们同样为本发明的主题。

[0269] 式 (I) 化合物以原样或以组合物形式使用, 用于以杀真菌有效量的活性成分处理真菌或需要保护以防止真菌侵袭的植物、植物繁殖材料 (如种子)、土壤、表面、材料或空间。施用可以在植物、植物繁殖材料如种子、土壤、表面、材料或空间被真菌侵染之前和之后进行。

[0270] 植物繁殖材料可以在种植或移栽时或在种植或移栽之前用式(I)化合物、其组合和组合物预防性地处理。

[0271] 本发明还涉及包含辅料和至少一种式(I)化合物的农化组合物。

[0272] 农化组合物包含杀真菌有效量的式(I)化合物。术语“有效量”表示所述组合物或式(I)化合物的足以在栽培植物上或在材料保护中控制有害真菌且不对被处理植物引起实质性损害的量。该量可以在宽范围内变化且取决于各种因素,如待防治的真菌品种、被处理的栽培植物或材料、气候条件以及所用具体式(I)化合物。

[0273] 式(I)化合物、其氧化物、金属配合物、异构体、多晶型物或其农业上可接受的盐可以转化成常用类型的农用化学品组合物,例如溶液剂、乳剂、混悬剂、粉剂(dusts)、散剂、糊剂、颗粒剂、模压品、胶囊剂及其混合物。组合物类型的实例是混悬液(例如SC、OD、FS),可乳化浓缩物(例如EC),乳液(例如EW、EO、ES、ME),胶囊(例如CS、ZC),糊剂,锭剂,可湿性粉末或粉剂(例如WP、SP、WS、DP、DS),模压品(例如BR、TB、DT),颗粒(例如WG、SG、GR、FG、GG、MG),杀虫制品(例如LN)以及处理植物繁殖材料(如种子)的凝胶配制剂(例如GF)。这些和其他组合物类型在“Catalogue of pesticide Formulation types and international coding system”, Technical Monograph, 第2期, 2008年5月第6版, CropLife International中有定义。

[0274] 组合物以已知方式制备,如Mollet and Grubemann, Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001; 或 Knowles, New developments in crop protection product formulation, Agrow Reports DS243, T&F Informa, London, 2005所述。

[0275] 合适的辅料是溶剂,液体载体,固体载体或填料,表面活性剂,分散剂,乳化剂,润湿剂,辅助剂,增溶剂,渗透促进剂,保护胶体,粘附剂,增稠剂,保湿剂,驱避剂,引诱剂,进食刺激剂,相容剂,杀菌剂,防冻剂,消泡剂,着色剂,增粘剂和粘合剂。

[0276] 合适的溶剂和液体载体是水和有机溶剂,如中到高沸点的矿物油馏分,例如煤油、柴油;植物或动物来源的油;脂族、环状和芳族烃类,例如甲苯、石蜡、四氢萘、烷基化萘;醇类,如乙醇、丙醇、丁醇、苜醇、环己醇;二醇类;DMSO;酮类,例如环己酮;酯类,例如乳酸酯、碳酸酯、脂肪酸酯、 γ -丁内酯;脂肪酸;磷酸酯;胺类;酰胺类,例如N-甲基吡咯烷酮、脂肪酸二甲基酰胺;以及它们的混合物。合适的固体载体或填料是矿物土,例如硅酸盐、硅胶、滑石、高岭土、石灰石、石灰、白垩、粘土、白云石、硅藻土、膨润土、硫酸钙、硫酸镁、氧化镁;多糖,例如纤维素、淀粉;肥料,例如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、脲类;植物来源的产品,例如谷粉、树皮粉、木粉和坚果壳粉,以及它们的混合物。

[0277] 合适的表面活性剂是表面活性化合物,如阴离子、阳离子、非离子和两性表面活性剂,嵌段聚合物,聚电解质,以及它们的混合物。这些表面活性剂可以用作乳化剂、分散剂、增溶剂、润湿剂、渗透促进剂、保护胶体或辅助剂。表面活性剂的实例列于McCutcheon's, Vol.1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008 (International Ed. 或 North American Ed.)中。

[0278] 合适的阴离子表面活性剂是磺酸、硫酸、磷酸、羧酸的碱金属、碱土金属或铵盐以及它们的混合物。磺酸盐的实例是烷基芳基磺酸盐、二苯基磺酸盐、 α -烯炔磺酸盐、木质素磺酸盐、脂肪酸和油的磺酸盐、乙氧基化烷基酚的磺酸盐、烷氧基化芳基酚的磺酸盐、缩合萘(condensed naphthalenes)的磺酸盐、十二烷基-和十三烷基苯的磺酸盐、萘和烷基萘的

磺酸盐、磺基琥珀酸盐或磺基琥珀酰胺酸盐。硫酸盐的实例是脂肪酸和油的硫酸盐、乙氧基化烷基酚的硫酸盐、醇的硫酸盐、乙氧基化醇的硫酸盐或脂肪酸酯的硫酸盐。磷酸盐的实例是磷酸盐酯。羧酸盐的实例是烷基羧酸盐以及羧化醇或烷基酚乙氧基化物。

[0279] 合适的非离子表面活性剂是烷氧基化物, N-取代的脂肪酸酰胺, 胺氧化物, 酯类, 糖基表面活性剂, 聚合物表面活性剂及其混合物。烷氧基化物的实例是诸如已经被1-50当量烷氧基化的醇、烷基酚、胺、酰胺、芳基酚、脂肪酸或脂肪酸酯的化合物。可以将氧化乙烯和/或氧化丙烯用于烷氧基化, 优选氧化乙烯。

[0280] N-取代的脂肪酸酰胺的实例是脂肪酸葡糖酰胺或脂肪酸链烷醇酰胺。酯类的实例是脂肪酸酯, 甘油酯或甘油单酯。糖基表面活性剂的实例是脱水山梨醇、乙氧基化脱水山梨醇、蔗糖和葡萄糖酯或烷基聚葡糖苷。聚合物表面活性剂的实例是乙烯基吡咯烷酮、乙烯醇或乙酸乙烯酯的均聚物或共聚物。

[0281] 合适的阳离子表面活性剂是季型表面活性剂, 例如具有一或两个疏水性基团的季铵化合物, 或长链伯胺的盐。合适的两性表面活性剂是烷基甜菜碱和咪唑啉类。合适的嵌段聚合物是包含聚氧乙烯和聚氧丙烯的嵌段的A-B或A-B-A类型嵌段聚合物, 或包含链烷醇、聚氧乙烯和聚氧丙烯的A-B-C类型嵌段聚合物。合适的聚电解质是聚酸或聚碱。聚酸的实例是聚丙烯酸的碱金属盐或聚酸梳状聚合物。聚碱的实例是聚乙烯基胺 (polyvinyl amines) 或聚乙烯胺 (polyethylene amines)。

[0282] 合适的辅助剂是本身具有可忽略的农药活性或者本身甚至没有农药活性且改善式(I)化合物对目标物的生物学性能的化合物。实例是表面活性剂, 矿物油或植物油以及其他助剂。Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, 第5章列出了其他实例。

[0283] 合适的增稠剂是多糖(例如黄原胶、羧甲基纤维素)、无机粘土(有机改性或未改性的)、聚羧酸盐和硅酸盐。

[0284] 合适的杀菌剂是溴硝丙二醇和异噻唑啉酮衍生物如烷基异噻唑啉酮和苯并异噻唑啉酮。

[0285] 合适的防冻剂是乙二醇、丙二醇、尿素和甘油。

[0286] 合适的消泡剂是聚硅氧烷、长链醇和脂肪酸盐。

[0287] 合适的着色剂(例如着红色、蓝色或绿色)是低水溶性颜料和水溶性染料。实例是无机着色剂(例如氧化铁、氧化钛、六氰合铁酸铁)和有机着色剂(例如茜素着色剂、偶氮着色剂和酞菁着色剂)。

[0288] 合适的增粘剂或粘合剂是聚乙烯吡咯烷酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇、聚丙烯酸酯、生物蜡或合成蜡以及纤维素醚。

[0289] 组合物类型及其制备的实例为:

[0290] i) 水溶性浓缩物(SL, LS)

[0291] 将10-60重量%的式(I)化合物和5-15重量%的润湿剂(例如醇烷氧基化物)溶于加至100重量%的水和/或水溶性溶剂(例如醇)中。活性物质在用水稀释时溶解。

[0292] ii) 可分散浓缩物(DC)

[0293] 将5-25重量%的式(I)化合物和1-10重量%的分散剂(例如聚乙烯吡咯烷酮)溶于加至100重量%的有机溶剂(例如环己酮)中。用水稀释得到分散体。

[0294] iii) 可乳化浓缩物 (EC)

[0295] 将15-70重量%的式 (I) 化合物和5-10重量%的乳化剂 (例如十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物) 溶于加至100重量%的水不溶性有机溶剂 (例如芳族烃) 中。用水稀释得到乳液。

[0296] iv) 乳液 (EW, E0, ES)

[0297] 将5-40重量%的式 (I) 化合物和1-10重量%的乳化剂 (例如十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物) 溶于20-40重量%的水不溶性有机溶剂 (例如芳族烃) 中。借助乳化机将该混合物引入加至100重量%的水中并制成均相乳液。用水稀释得到乳液。

[0298] v) 悬浮液 (SC, OD, FS)

[0299] 将20-60重量%的式 (I) 化合物与加入的2-10重量%的分散剂和润湿剂 (例如木质素磺酸钠和醇乙氧基化物)、0.1-2重量%的增稠剂 (例如黄原胶) 和加至100重量%的水在搅拌的球磨机中粉碎, 得到精细活性物质悬浮液。用水稀释得到稳定的活性物质悬浮液。对于FS类型组合物加入最高至40重量%的粘合剂 (例如聚乙烯醇)。

[0300] vi) 水分散性颗粒和水溶性颗粒 (WG, SG)

[0301] 精细研磨50-80重量%的式 (I) 化合物与加入的加至100重量%的分散剂和润湿剂 (例如木质素磺酸钠和醇乙氧基化物) 并借助技术装置 (例如挤出机、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物质分散体或溶液。

[0302] vii) 水分散性粉末和水溶性粉末 (WP, SP, WS)

[0303] 在转子-定子磨机中研磨50-80重量%的式 (I) 化合物和加入的1-5重量%分散剂 (例如木质素磺酸钠)、1-3重量%润湿剂 (例如醇乙氧基化物) 和加至100重量%的固体载体 (例如硅胶)。用水稀释得到稳定的活性物质分散体或溶液。

[0304] viii) 凝胶 (GW, GF)

[0305] 在搅拌的球磨机中粉碎5-25重量%的式 (I) 化合物和加入的3-10重量%的分散剂 (例如木质素磺酸钠)、1-5重量%的增稠剂 (例如羧甲基纤维素) 和加至100重量%的水, 得到活性物质的精细悬浮液。用水稀释得到稳定的活性物质悬浮液。

[0306] ix) 微乳液 (ME)

[0307] 将5-20重量%的式 (I) 化合物加入至5-30重量%的有机溶剂共混物 (例如脂肪酸二甲基酰胺和环己酮)、10-25重量%的表面活性剂共混物 (例如醇乙氧基化物和芳基酚乙氧基化物) 和加至100重量%的水中。将该混合物搅拌1小时, 以自发产生热力学稳定的微乳液。

[0308] x) 微胶囊 (CS)

[0309] 将包含5-50重量%的式 (I) 化合物、0-40重量%的水不溶性有机溶剂 (例如芳族烃)、2-15重量%的丙烯酸系单体 (例如甲基丙烯酸甲酯、甲基丙烯酸和二丙烯酸酯或三丙烯酸酯) 的油相分散到保护胶体 (例如聚乙烯醇) 的水溶液中。自由基聚合导致形成聚 (甲基) 丙烯酸酯微胶囊。或者, 将包含5-50重量%的根据本发明的式 (I) 化合物、0-40重量%的水不溶性有机溶剂 (例如芳族烃) 和异氰酸酯单体 (例如二苯基甲烷-4,4'-二异氰酸酯) 的油相分散到保护胶体 (例如聚乙烯醇) 的水溶液中。加入多胺 (例如六亚甲基二胺) 导致形成聚脲微胶囊。单体量为1-10重量%。重量%涉及整个CS组合物。

[0310] xi) 粉剂 (DP, DS)

[0311] 将1-10重量%的式(I)化合物精细研磨并与加至100重量%的固体载体(例如精细粉碎高岭土)充分混合。

[0312] xii) 颗粒(GR,FG)

[0313] 将0.5-30重量%的式(I)化合物精细研磨并结合加至100重量%的固体载体(例如硅酸盐)。通过挤出、喷雾干燥或流化床实现造粒。

[0314] xiii) 超低容量液体(UL)

[0315] 将1-50重量%的式(I)化合物溶于加至100重量%的有机溶剂(例如芳族烃)中。

[0316] 组合物类型i) -xiii) 可以任选包含其他辅料,如0.1-1重量%的杀菌剂,5-15重量%的防冻剂,0.1-1重量%的消泡剂和0.1-1重量%的着色剂。

[0317] 农用化学品组合物通常包含0.01-95重量%,优选0.1-90重量%,尤其是0.5-75重量%的活性成分(ai)。活性成分(ai)以90%-100%,优选95%-100%的纯度(根据NMR光谱)使用。

[0318] 为了处理植物繁殖材料,尤其是种子,通常使用种子处理用溶液(LS),悬浮乳液(SE),可流动浓缩物(FS),干处理用粉末(DS),淤浆处理用水分散性粉末(WS),水溶性粉末(SS),乳液(ES),可乳化浓缩物(EC)和凝胶(GF)。所述组合物在稀释2-10倍后在即用制剂中给出0.01-60重量%,优选0.1-40重量%的活性物质浓度。

[0319] 施用可以在播种之前或期间进行。式(I)化合物、其组合和组合物分别在植物繁殖材料,尤其是种子上的施用方法包括拌种、包衣、造粒、撒粉和浸泡以及犁沟内施用方法。优选通过不诱发萌发的方法,例如通过拌种、造粒、包衣和撒粉将式(I)化合物、其组合和组合物分别施用于植物繁殖材料上。

[0320] 当用于植物保护中时,活性物质的施用量取决于所需效果的种类,为0.001-2kg/ha,优选0.005-2kg/ha,更优选0.05-0.9kg/ha,尤其是0.1-1.0kg/ha。

[0321] 在植物繁殖材料如种子例如通过撒粉、包衣或浸透种子的处理中,每100kg植物繁殖材料(优选种子)通常要求活性物质的量为0.1-1000g,优选1-1000g,更优选1-100g,最优选5-100g。

[0322] 当用于保护材料或储存产品中时,活性物质的施用量取决于施用区域的种类和所需效果。在材料保护中常用的施用量例如为0.001g-2kg,优选0.005g-1kg活性物质/立方米被处理材料。

[0323] 可以向活性物质或包含它们的组合物中作为预混物加入或者合适的话在紧临使用前加入(桶混合)各种类型的油、润湿剂、辅助剂、肥料或微营养素和其他农药(例如除草剂、杀虫剂、杀真菌剂、生长调节剂、安全剂、生物农药)。这些试剂可以以1:100-100:1,优选1:20-20:1的重量比与根据本发明的组合物混合。

[0324] 农药通常为通过其效果将有害物阻止、失能、杀灭或在其他方面受挫的化学或生物药剂(如农药活性成分、化合物、组合物、病毒、细菌、抗微生物剂或消毒剂)。目标有害物可以包括破坏财产、引起麻烦、传播疾病或为疾病媒介物的昆虫、植物病原体、杂草、软体动物、鸟类、哺乳动物、鱼类、线虫(蛔虫)和微生物。术语“农药”还包括改变植物的预期生长、开花或繁殖率的植物生长调节剂;引起叶子或其他树叶从植物脱落通常促进收获的落叶剂;促进活体组织,如不希望的植物顶端干燥的干燥剂;活化植物生理机能以防御某些有害物的植物活化剂;降低农药对农作物的不希望除草作用的安全剂;以及影响植物生理机能

例如以增强植物生长、生物质、产量或农作物的可收获物品的任何其他质量参数的植物生长促进剂。

[0325] 用户通常从预配药装置、背负式喷雾器、喷雾罐、喷雾飞机或灌溉系统施用根据本发明的组合物。通常,农用化学品组合物用水、缓冲剂和/或其他辅料配制至所需施用浓度,从而得到即用喷雾液或根据本发明的农用化学品组合物。通常,每公顷农业有用区通常施用20-2000升,优选50-400升即用喷雾液。

[0326] 根据一个实施方式,用户可以自己在喷雾罐或任何其他种类用于施用的容器(例如种子处理转鼓、种子造粒机、背负式喷雾器)中混合根据本发明的组合物的各个组分,例如试剂盒(kit)的各部分或二元或三元混合物的各部分,并且合适的话可以加入其他辅料。

[0327] 因此,本发明的一个实施方式为一种制备有用农药组合物的试剂盒,该试剂盒包含a)包含本文所定义的组分1)和至少一种辅料的组合物;和b)包含本文所定义的组分2)和至少一种辅料的组合物;以及任选c)包含至少一种辅料和任选本文所定义的另一活性组分3)的组合物。

[0328] 将式(I)化合物、其组合和组合物在包含它们用作杀真菌剂与其他杀真菌剂一起可导致所获得的杀真菌活性谱拓宽或防止杀真菌剂抗药性的发展。此外,在许多情况下得到超凡的作用。

[0329] 在一个实施方式中,本发明提供了包含至少一种式(I)化合物和至少一种选自杀真菌剂、杀虫剂、杀线虫剂、杀螨剂、生物杀虫剂、除草剂、安全剂、植物生长调节剂、抗生素、肥料和营养物的其他农药活性物质的组合。在W02015185485第36-43页和W02017093019第42-56页中报道的农药活性物质可以与式(I)化合物结合使用。

[0330] 称为组分2的活性物质、其制备及其例如对有害真菌的活性是已知的(参见:<http://www.alanwood.net/pesticides/>);这些物质可商购。由IUPAC命名法描述的化合物、其制备及其农药活性也是已知的(参见Can. J. Plant Sci. 48(6), 587-94, 1968; EP141317; EP152031; EP226917; EP243970; EP256503; EP428941; EP532022; EP1028125; EP1035122; EP1201648; EP1122244, JP2002316902; DE19650197; DE10021412; DE102005009458; US3296272; US3325503; W09846608; W09914187; W09924413; W09927783; W00029404; W00046148; W00065913; W00154501; W0 0156358; W00222583; W00240431; W00310149; W00311853; W00314103; W00316286; W00353145; W00361388; W00366609; W00374491; W00449804; W00483193; W005120234; W005123689; W005123690; W00563721; W00587772; W00587773; W00615866; W00687325; W00687343; W00782098; W00790624; W011028657; W02012168188; W02007006670; W0201177514; W013047749; W010069882; W013047441; W00316303; W00990181; W013007767; W01310862; W013127704; W013024009; W013024010; W013047441; W013162072; W013092224和W011135833。

[0331] 本发明还涉及包含至少一种式(I)化合物(组分1)和至少一种用于植物保护的其他活性物质的农用化学品混合物。

[0332] 通过将式(I)化合物与至少一种农药活性化合物一起施用,可以获得额外的效果。

[0333] 这可以通过同时,联合(例如作为桶混物)或分开,或依次施用式(I)化合物和至少一种其他农药活性物质而得到,其中选择各次施用之间的时间间隔以确保最初施用的活性物质在施用其他农药活性物质时仍以足够量存在于作用场所。施用顺序对本发明的实施并

不重要。

[0334] 当依次施用式(I)化合物和农药活性物质时,两次施用之间的时间可以在例如2小时至7天间变化。0.25小时至30天,优选0.5小时至14天,特别是1小时至7天或1.5小时至5天,甚至更优选2小时至1天的更宽范围也是可能的。在根据本发明的二元混合物和组合物中,组分1)和组分2)的重量比通常取决于所用活性组分的性能,通常为1:1000-1000:1,常常为1:100-100:1,经常为1:50-50:1,优选1:20-20:1,更优选1:10-10:1,甚至更优选1:4-4:1,尤其是1:2-2:1。

[0335] 根据二元混合物及其组合物的其他实施方式,组分1)和组分2)的重量比通常为1000:1-1:1000,常常为100:1-1:100,经常为50:1-1:50,优选20:1-1:20,更优选10:1-1:10,甚至更优选4:1-1:4,尤其是2:1-1:2。

[0336] 在三元混合物,即包含组分1)和组分2)和化合物III(组分3)的根据本发明的组合物中,组分1)和组分2)的重量比取决于所用活性物质的性能,通常为1:100-100:1,常常为1:50-50:1,优选1:20-20:1,更优选1:10-10:1,尤其是1:4-4:1,且组分1)和组分3)的重量比通常为1:100-100:1,常常为1:50-50:1,优选1:20-20:1,更优选1:10-10:1,尤其是1:4-4:1。

[0337] 需要的话,任何其他活性组分可以20:1-1:20的比例加入组分1)中。

[0338] 这些比例也适合通过种子处理施用的本发明混合物。

[0339] 本发明还涉及制备本发明化合物的方法。本发明化合物的制备方法在实验部分有更详细的描述。

[0340] 现将借助于非限制性方案和实施例详细阐述本公开中公开的发明。

[0341] 化学实施例:

[0342] 实施例1:N-(3-甲氧基苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺(化合物1)

[0343] 步骤1:7-氰基咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯

[0344] 向搅拌的2-氨基异烟腈(0.5g,4.2mmol)的四氢呋喃(0.5mL)溶液中加入溴丙酮酸乙酯(0.77mL,6.1mmol)并在25℃下搅拌24小时。此外,向该反应混合物中加入乙酸(1mL,17.5mmol)并回流16小时。减压除去挥发物,将己烷(10mL)加入所得残余物中并搅拌30分钟。过滤沉淀物,用己烷(5mL)洗涤并减压干燥以获得7-氰基咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯(1g,产率58%)。

[0345] 步骤2:7-(N'-羟基甲脒基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯

[0346] 在25℃下,向搅拌的7-氰基咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯(6.2g,29mmol)的乙醇(100mL)悬浮液中加入羟胺(3.64mL,58mmol)并将所得反应混合物在40℃下搅拌16小时。在减压下除去挥发物以获得粗品7-(N'-羟基甲脒基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯(7g)。

[0347] 步骤3:7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯

[0348] 在0℃下向搅拌的7-(N'-羟基甲脒基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯(6g,24.2mmol)的四氢呋喃(60mL)悬浮液中加入三氟乙酸酐(13.7mL,97mmol)。将所得反应混合物在25℃搅拌24小时。通过在0-5℃下倒入饱和碳酸氢钠水溶液(100mL)中来淬灭反应混合物。将产物萃取到乙酸乙酯(150mL)中。乙酸乙酯层用水(50mL)洗涤,无水硫酸钠干燥,减压

浓缩得到粗品。向该粗品中加入己烷 (60mL) 并将混合物搅拌30分钟。过滤所得浆液,用己烷 (30mL) 洗涤并减压干燥,得到7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯 (6.5g,产率82%)。

[0349] 步骤4:N-(3-甲氧基苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺

[0350] 在0-5℃下向搅拌的7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯 (0.3g,0.9mmol) 在甲苯中的溶液 (3mL) 加入间-茴香胺 (0.2mL,1.8mmol) 和三甲基铝 (2M的甲苯溶液) (1.0mL,2.0mmol) 并在25℃下搅拌直至停止冒泡。将所得反应混合物在65℃下搅拌16小时。将反应混合物冷却至25℃并倒入10%乙酸水溶液 (10mL) 中。产物用乙酸乙酯 (30mL) 萃取。乙酸乙酯层用碳酸氢钠水溶液 (10mL) 洗涤,无水硫酸钠干燥,减压浓缩得到粗品。粗品经硅胶柱色谱纯化得到N-(3-甲氧基苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺 (180mg,产率49%)。¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆) δ 10.35 (s, 1H), 8.84 (dd, 1H), 8.73 (d, 1H), 8.27-8.26 (m, 1H), 7.62-7.59 (m, 2H), 7.52-7.49 (m, 1H), 7.25 (t, 1H), 6.68 (dd, 1H), 3.76 (s, 3H); LCMS (M+H): 404.15。

[0351] 表1:通过与化合物1类似的过程制备以下化合物

化合物编号	IUPAC 名称	分析数据
[0352] 2	N-(4-甲氧基苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.30 (s, 1H), 8.83 (dd, 1H), 8.70 (d, 1H), 8.26 (t, 1H), 7.81-7.78(m, 2H), 7.60 (dd, 1H), 6.94-6.91(m, 2H), 3.74 (s, 3H); LCMS (M+H): 404.1

[0353]

3	N-(对甲苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.29 (s, 1H), 8.83 (dd, 1H), 8.71 (d, 1H), 8.27-8.26(m, 1H), 7.79-7.76(m, 2H), 7.61 (dd, 1H), 7.15 (d., 2H), 2.28 (s, 3H); LCMS (M+H): 388.1
4	N-(3-氟苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.059 (s, 1H), 8.88 (dd, 1H), 8.74 (d, 1H), 8.305 (t, 1H), 7.876 (dt, 1H), 7.62-7.59 (dd, 1H), 7.41-7.35 (m, 1H), 7.41-7.35 (m, 1H), 7.15-7.17 (td, 1H); LCMS (M+H): 392.05
5	N-(2,4-二氟苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.059 (s, 1H), 8.84 (dd, 1H), 8.744, 1H), 8.30(t, 1H), 7.86 (td, 1H), 7.62 (dd, 1H), 7.43-7.37 (m, 1H), 7.17-7.15(m, 1H); LCMS (M+H): 410.05
6	N-(4-氯苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.60 (s, 1H), 8.83 (dd, 1H), 8.75(d, 1H), 8.26 (t, 1H), 7.96-7.94(m, 2H), 7.61 (dd, 1H), 7.42-7.39(m, 2H); LCMS (M+H): 408.05
7	N-(2-氟苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.95 (s, 1H), 8.83 (dd, 1H), 8.76 (d, 1H), 8.33 (t, 1H), 8.02-7.96 (m, 1H), 7.61 (dd, 1H), 7.35-7.30 (m, 1H), 7.25-7.201 (m, 2H); LCMS (M+H): 392.05
8	7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(4-(三氟甲基)苄基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.23 (t, 1H), 8.80 (dd, 1H), 8.60 (d, 1H), 8.22 (t, 1H), 7.68 (d, 2H), 7.58-7.53 (m, 3H), 4.56 (d, 2H); LCMS (M+H): 456.15
9	N-(吡啶-3-基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.73 (s, 1H), 9.07-9.06 (m, 1H), 8.84 (dd, 1H), 8.77 (d, 1H), 8.32-8.27 (m, 3H), 7.62 (dd, , 1H), 7.41-7.37 (m, 1H); LCMS (M+H): 375.1
10	N-苄基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.06 (t, 1H), 8.79 (d, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.57 (dd,

[0354]

	-2-甲酰胺	¹ H), 7.35-7.29 (m, 4H), 7.24-7.21 (m, 1H), 4.48 (d, 2H); LCMS (M+H): 388.15
11	N-(吡啶-4-基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 10.85 (s, 1H), 8.84 (dd, 1H), 8.80 (d, 1H), 8.47 (dd, 2H), 8.27 (t, 1H), 7.94-7.92 (m, 2H), 7.62 (dd, 1H); LCMS (M+H): 375.1
12	N-(4-氯苯基)-N-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.70 (d, 1H), 8.23 (s, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.48 (dd, 1H), 7.39-7.37(m, 2H), 7.295-7.273 (m, 2H), 3.46 (s, 3H); LCMS (M+H): 422.1
13	N-甲基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.78 (dd, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.46 (q, 1H), 8.19 (t, 1H), 7.55 (dd, 1H), 2.80 (d, 3H); LCMS (M+H): 312.05
14	N-甲基-N-(2-苯氧基乙基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) @ 80 degree celcius δ 8.74 (dd, 1H), 8.45 (s, 1H), 8.23 (s, 1H), 7.50 (dd, 1H), 7.23 (t, 2H), 6.93-6.89 (m, 3H), 4.27 (t, 2H); LCMS (M+H): 432.1
15	N-(4-氰基苯基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿- <i>D</i>) δ 9.48 (s, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.36 (s, 1H), 8.33 (dd, 1H), 7.93-7.91(m, 2H), 7.70-7.68 (m, 2H), 7.63 (dd, 1H); LCMS (M+H): 399.05
33	氮杂环丁烷-1-基(7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲酮	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.76 (dd, 1H), 8.56 (d, 1H), 8.24 (t, 1H), 7.55 (dd, 1H), 4.65 (t, 2H), 4.07 (t, 2H), 2.35-2.27 (m, 2H); LCMS (M+H): 338.15.
34	N-(2-甲氧基乙基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.79 (d, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.36 (s, 1H), 8.23 (s, 1H), 7.56 (dd, 1H), 3.47-3.44 (m, 4H), 3.27 (s, 3H); LCMS (M+H): 355.70.
35	N-异丁基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.78 (dd, 1H), 8.56 (s, 1H), 8.46 (t, 1H), 8.22 (d, 1H), 7.56 (dd,

[0355]

	[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H), 3.11 (t, 2H), 1.91-1.84 (m, 1H), 0.87 (d, 6H); LCMS (M+H): 353.70.
36	N-新戊基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.79 (dd, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.25-8.22 (m, 2H), 7.56 (dd, 1H), 3.14 (d, 2H), 0.88 (d, 9H); LCMS (M+H): 368.30.
37	N-异戊基-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.79-8.76 (m, 1H), 8.54 (d, 1H), 8.44 (t, 1H), 8.20 (t, 1H), 7.59-7.54 (m, 1H), 3.33-3.28 (m, 2H), 1.59 (td, 1H), 1.43 (q, 2H), 0.90 (d, 6H); LCMS (M+H): 368.05
38	N-(4-氯苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.13 (s, 1H), 8.79 (dd, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.57 (dd, 1H), 7.36 (dd, 4H), 4.46 (d, 2H); LCMS (M+H): 421.85.
39	N-(4-甲氧基苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.95 (t, 1H), 8.79 (dd, 1H), 8.58 (d, 1H), 8.21 (t, 1H), 7.56 (dd, 1H), 7.26 (d, 2H), 6.87 (dd, 2H), 4.40 (d, 2H), 3.71 (s, 3H); LCMS (M+H): 418.05.
40	N-(3-氯苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.17 (t, 1H), 8.79 (dd, 1H), 8.60 (d, 1H), 8.22 (t, 1H), 7.58-7.48 (m, 1H), 7.38-7.28 (m, 4H), 4.47 (d, 2H); LCMS (M+H): 421.85.
41	N-(3-甲氧基苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.03 (t, 1H), 8.79 (dd, 1H), 8.59 (d, 1H), 8.22 (t, 1H), 7.56 (dd, 1H), 7.24-7.20 (m, 1H), 6.91-6.78 (m, 3H), 4.45 (d, 2H), 3.72 (s, 3H); LCMS (M+H): 417.95.
42	N-(2-氟苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.03 (t, 1H), 8.79 (dd, 1H), 8.60 (d, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.57 (dd, 1H), 7.38-7.13 (m, 4H), 4.54 (d, 2H);

		LCMS (M+H): 406.15.
[0356]	43 N-(4-(二甲基氨基)苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.82-8.78 (m, 2H), 8.57 (d, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.55 (dd, 1H), 7.17 (d, 2H), 6.67 (d, 2H), 4.35 (d, 2H), 2.84 (s, 6H); LCMS (M+H): 430.95.
	44 N-(3,4-二氯苄基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.21 (t, 1H), 8.79 (dd, 1H), 8.60 (d, 1H), 8.22 (t, 1H), 7.59-7.56 (m, 3H), 7.33 (dd, 1H), 4.46 (d, 2H); LCMS (M+H): 455.85.

[0357] 实施例2:N-(3-甲氧基苄基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺(化合物16)

[0358] 步骤1:6-氰基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-甲酸乙酯

[0359] 在0-5℃下,向搅拌的6-氨基烟腈(6g,50.4mmol)的四氢呋喃(80mL)溶液中滴加溴丙酮酸乙酯(7.0mL,55.4mmol)。将所得反应混合物在25℃下搅拌24小时。在减压下除去挥发物。在25℃下向所得残余物中加入乙醇(80mL)和乙酸(23mL,403mmol)并将所得反应混合物在80℃下搅拌18小时。将反应混合物冷却至0-5℃并用150mL乙酸乙酯稀释。将饱和碳酸氢钠水溶液加入到反应混合物中直到pH变为碱性。分离乙酸乙酯层,用水(50mL)、盐水溶液(50mL)洗涤,无水硫酸钠干燥,减压浓缩得到6-氰基咪唑并[1,2-a]吡啶-3-甲酸乙酯(9g,产率83%)。

[0360] 步骤2:6-(N'-羟基甲脒基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸甲酯

[0361] 在15℃下,向搅拌的6-氰基咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯氢溴酸盐(1g,3.38mmol)在甲醇(7mL)和水(3mL)的混合物中的溶液中加入盐酸羟胺(0.35g,5.0mmol)和碳酸氢钠(0.9g,10.1mmol)。将所得反应混合物在25℃下搅拌24小时。在减压下除去挥发物以获得粗品。向粗品中加入水(30mL)并在0-5℃下搅拌1小时。过滤所得浆液,用水(10mL)洗涤并真空干燥。将所得固体化合物与10mL丙酮在0-5℃下搅拌15分钟,过滤,用己烷(10mL)洗涤并真空干燥,得到6-(N'-羟基甲脒基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯(0.75g,产率89%)。

[0362] 步骤3:6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯

[0363] 在0-5℃下,向搅拌的6-(N'-羟基甲脒基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯(1.3g,5.2mmol)在四氢呋喃(20mL)的悬浮液中加入三氟乙酸酐(2.2mL,15.7mmol)。将所得反应混合物在25℃下搅拌24小时。反应混合物用己烷(20mL)稀释,过滤并真空干燥获得固体。固体用二氯甲烷(30mL)稀释,冷却至0-5℃并用饱和碳酸氢钠水溶液碱化。分离二氯甲烷层,用水(10mL)洗涤,无水硫酸钠干燥,减压浓缩得到6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯(1.5g,产率88%)。

[0364] 步骤4:N-(3-甲氧基苄基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺

[0365] 在0-5℃下,向搅拌的6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯(250mg,0.7mmol)的甲苯(2.5mL)溶液中加入间茴香胺(94mg,0.7mmol)和三

甲基铝 (0.8mL, 1.5mmol)。将所得反应混合物在70℃搅拌24小时。将反应混合物冷却至25℃并倒入在0-5℃下的10%乙酸水溶液 (10mL) 中。产物用乙酸乙酯 (30mL) 萃取。乙酸乙酯层用碳酸氢钠水溶液 (10mL) 洗涤, 无水硫酸钠干燥, 减压浓缩得到粗品。粗品经硅胶柱色谱纯化得到N-(3-甲氧基苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺 (184mg, 产率55%)。¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆) δ 10.34 (s, 1H), 9.59 (q, 1H), 8.71 (d, 1H), 7.91 (dd, 1H), 7.85-7.87 (m, 1H), 7.60 (t, 1H), 7.52-7.50 (m, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.69 (dd, 1H), 3.75 (s, 3H); LCMS (M+H): 404.15。

[0366] 表2: 通过与化合物16类似的过程制备以下化合物

化合物编号	IUPAC 名称	分析数据
17	N-(2,4-二氟苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.04 (s, 1H), 9.57 (t, 1H), 8.72 (s, 1H), 7.93-7.82 (m, 3H), 7.41-7.35(m, 1H), 7.16-7.10(m, 1H); LCMS (M+H): 410.15
[0367] 18	N-(4-氯苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.59 (s, 1H), 9.58 (q, 1H), 8.72 (d, 1H), 7.97-7.93(m, 2H), 7.92-7.89 (m,1H), 7.87-7.85(m, 1H), 7.42-7.38 (m, 2H); LCMS (M+H): 408.15
19	N-(对甲苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.28 (s, 1H), 9.58 (s, 1H), 8.69 (s, 1H), 7.91-7.86 (m, 2H), 7.77 (d, 2H), 7.14 (d, 2H), 2.27 (s, 3H); LCMS (M+H): 388.15
20	N-(2-氟苯基)-6-(5-(三氟甲	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.93 (s, 1H), 9.58

[0368]

	基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	(t, 1H), 8.73 (s, 1H), 8.03-7.98 (m, 1H), 7.92 (d, 2H), 7.35-7.30(m, 1H), 7.26-7.21(m, 2H); LCMS (M+H): 391.95
21	N-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.53 (q, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.48-8.44(m, 1H), 7.85 (dd, 1H), 7.79-7.76 (m, 1H), 2.79 (d, 3H); LCMS (M+H): 312.15
22	N-(4-甲氧基苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.27 (s, 1H), 9.58 (s, 1H), 8.68 (s, 1H), 7.91-7.88(m, 1H), 7.86-7.84 (m,1H), 7.81-7.82(m,2H), 6.92 (d, 2H), 3.74 (s, 3H); LCMS (M+H): 403.8
23	N-苄基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (q, 1H), 9.05 (t, 1H), 8.57 (s, 1H), 7.87 (dd, 1H), 7.81-7.78 (m, 1H), 7.34-7.28(m, 4H), 7.24-7.20(m, 1H), 4.47 (d, 2H); LCMS (M+H): 388.15
24	N-(3-氟苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.64 (s, 1H), 9.58 (q, 1H), 8.73 (s, 1H), 7.93-7.85 (m, 3H), 7.76-7.74 (m, 1H), 7.41-7.34 (m, 1H), 6.92 (td, 1H); LCMS (M+H): 392
25	N,N-二甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.52 (t, 1H), 8.49 (s, 1H), 7.85-7.80(m, 2H), 3.41 (s, 3H), 3.01 (s, 3H); LCMS (M+H): 326.15
26	N-(4-氯-2-氟苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.03 (s, 1H), 9.57 (t, 1H), 8.74 (s, 1H), 7.98-7.88 (m, 3H), 7.56 (dd, 1H), 7.35-7.32 (m, 1H); LCMS (M+H): 425.95
27	N-(4-氰基苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.90 (s, 1H), 9.59 (t, 1H), 8.77 (s, 1H), 8.15-8.13(m, 2H), 7.92 (dd, 1H), 7.88-7.86(m,1H), 7.83-7.81 (m 2H); LCMS (M+H): 399
28	N-(2-甲氧基苯基)-6-(5-(三氟	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.76 (s,1H), 9.57

[0369]

	甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	(t, 1H), 8.71 (d, 1H), 8.40-8.38 (m, 1H), 7.94-7.81 (m, 2H), 7.15-7.09 (m, 2H), 7.01-6.94 (m, 1H), 3.95 (s, 3H); LCMS (M+H): 404.1
29	N-(吡啶-3-基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.70 (s, 1H), 9.59 (t, 1H), 9.07 (d, 1H), 8.74 (d, 1H), 8.31-8.28 (m, 2H), 7.92 (dd, 1H), 7.87 (d, 1H), 7.38 (dd, 1H); LCMS (M+H): 374.8
30	N-(2,6-二氟苯基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.21(s, 1H), 9.57 (q, 1H), 8.70 (d, 1H), 7.92 (dd, 1H), 7.87-7.85 (m,1H), 7.44-7.36 (m, 1H), 7.22-7.16 (m, 2H); LCMS (M+H): 410.15
31	N-(3-氟苄基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (q, 1H), 9.15 (t, 1H), 8.58 (s, 1H), 7.87 (dd, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.38-7.32 (m, 1H), 7.17-7.11 (m, 2H), 7.07-7.03 (m, 1H), 4.48 (d, 2H); LCMS (M+H): 405.8
32	N-(吡啶-4-基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿- <i>D</i>) δ 9.35 (s, 1H), 9.07 (q, 1H), 8.58 (dd, 2H), 8.37 (d, 1H), 7.98 (dd, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.70 (dd, 2H); LCMS (M+H): 374.75
63	6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-N-(4-(三氟甲基)苄基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (q, 1H), 9.23 (t, 1H), 8.58 (s, 1H), 7.88 (dd, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.68 (d, 2H), 7.53 (d, 2H), 4.55 (d, 2H); LCMS (M+H): 456.05.
64	吗啉(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲酮	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.53 (s, 1H), 8.55 (s, 1H), 7.86-7.81 (m, 2H), 4.20 (s, 2H), 3.65 (s, 6H); LCMS (M+H): 367.70.
65	N-(2-甲氧基乙基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (s, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.36 (d, 1H), 7.86 (dd, 1H), 7.80 (d, 1H), 3.45 (d, 4H), 3.26 (s, 3H); LCMS (M+H): 355.80.
66	N-异丁基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.53 (d, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.45 (t, 1H), 7.86 (dd, 1H), 7.79 (d,

[0370]

	并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H), 3.10 (t, 2H), 1.90-1.83 (m, 1H), 0.87 (d, 6H); LCMS (M+H): 353.80.
67	N-环戊基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.53 (s, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.24 (d, 1H), 7.86 (dd, 1H), 7.78 (d, 1H), 4.24 (q, 1H), 1.91-1.82 (m, 2H), 1.70-1.68 (m, 2H), 1.60-1.52 (m, 4H); LCMS (M+H): 365.80.
68	(3-甲氧基吡咯烷-1-基)(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲酮	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.53 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 7.84-7.81 (m, 2H), 4.23-4.17 (m, 1H), 4.05-3.88 (m, 2H), 3.65-3.48 (m, 2H), 3.24 (d, 3H), 2.11-1.89 (m, 2H); LCMS (M+H): 381.75.
69	氮杂环丁烷-1-基(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲酮	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.52 (s, 1H), 8.56 (s, 1H), 7.85-7.79 (m, 2H), 4.64 (t, 2H), 4.06 (t, 2H), 2.34-2.26 (m, 2H); LCMS (M+H): 338.00.
70	N-(环丙基甲基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (t, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.51 (t, 1H), 7.86 (dd, 1H), 7.79 (d, 1H), 3.15 (t, 2H), 1.09-1.02 (m, 1H), 0.43-0.39 (m, 2H), 0.26-0.22 (m, 2H); LCMS (M+H): 351.75.
71	N-苄基-N-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (s, 1H), 8.58 (d, 1H), 7.82 (d, 2H), 7.37-7.27 (m, 5H), 5.31 (s, 1H), 4.71 (s, 1H), 3.35 (s, 2H), 2.89 (s, 2H); LCMS (M+H): 401.80.
72	N-(1-苯基乙基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.53 (s, 1H), 8.78 (d, 1H), 8.54 (s, 1H), 7.87 (dd, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.42 (d, 2H), 7.31 (t, 2H), 7.21 (t, 1H), 5.21-5.14 (m, 1H), 1.51 (d, 3H); LCMS (M+H): 401.75.
73	N-(1-氰基环丙基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (t, 2H), 8.64 (s, 1H), 7.88 (dd, 1H), 7.79 (d, 1H), 1.55-1.48 (m, 2H), 1.37-1.25 (m, 2H); LCMS (M+H): 362.65.
74	N-(甲氧基甲基)-N-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.51 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 7.85-7.80 (m, 2H), 4.11 (t, 1H),

	唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	3.63-3.43 (m, 4H), 3.28 (s, 1H), 3.19 (s, 2H), 3.02 (s, 2H); LCMS (M+H): 370.30.
[0371]	75 N-(3-氯苄基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (q, 1H), 9.17 (t, 1H), 8.58 (s, 1H), 7.89-7.79 (m, 2H), 7.37-7.27 (m, 4H), 4.47 (d, 2H); LCMS (M+H): 421.95.
	76 N-(3-甲氧基苄基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (d, 1H), 9.03 (s, 1H), 8.57 (d, 1H), 7.88-7.81 (m, 2H), 7.22 (t, 1H), 6.90 (s, 2H), 6.81 (s, 1H), 4.44 (d, 2H), 3.72 (s, 3H); LCMS (M+H): 418.20.
	77 N-(4-氯苄基)-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (q, 1H), 9.13 (t, 1H), 8.57 (d, 1H), 7.88-7.78 (m, 2H), 7.38-7.33 (m, 4H), 4.45 (d, 2H); LCMS (M+H): 421.90.
	78 N-异丁基-N-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.53 (t, 1H), 8.50 (d, 1H), 7.85 (d, 2H), 3.85 (d, 1H), 3.36 (d, 3H), 3.01 (s, 1H), 2.03 (dt, 1H), 0.92 (d, 3H), 0.80 (d, 3H); LCMS (M+H): 368.30.

[0372] 实施例3:3-(2-(苄硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(化合物50)的制备

[0373] 步骤1:2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈

[0374] 向搅拌的2-氨基异烟腈(20g,168mmol)的乙醇(100mL)溶液中加入1,3-二氯丙-2-酮(38.4g,302mmol)并在50℃下搅拌16小时。反应混合物用饱和碳酸氢钠水溶液(500mL)淬灭,所得沉淀物经布氏漏斗过滤,所得固体用乙醇(50mL)洗涤。将所得残余物在减压下干燥以获得2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈(21g,110mmol,产率65%)。

[0375] 步骤2:2-(氯甲基)-N'-羟基咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈

[0376] 在25℃下,向搅拌的2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈(10.25g,53.5mmol)的乙醇(50mL)溶液中加入50wt.%的羟胺水溶液(6.56mL,107mmol)。将所得反应混合物在60℃下搅拌3小时并减压浓缩,得到2-(氯甲基)-N'-羟基咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈(11.54g,53.5mmol,产率96%)。

[0377] 步骤3:3-(2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑

[0378] 在氮气氛下在0-5℃下,向搅拌的2-(氯甲基)-N'-羟基咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈(12.0g,53.4mmol)的四氢呋喃(50mL)溶液中缓慢加入三氟乙酸酐(13.58mL,96mmol),并在25℃下搅拌18小时。减压浓缩所得反应混合物并将所得残余物溶解于二氯甲烷(100mL)中。二氯甲烷层用碳酸氢钠水溶液(50mL)洗涤,然后用盐水(50mL)洗涤,经无水硫酸钠干燥并减压浓缩。粗品通过硅胶快速柱色谱纯化,洗脱液为60%乙酸乙酯的己烷溶液,得到3-(2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(12.56g,

41.5mmol,产率78%)。

[0379] 步骤4:3-(2-((苯硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑向氮气氛下搅拌的苯硫醇(0.473g,4.30mmol)的乙腈(8mL)溶液中加入碳酸钾(0.91g,6.6mmol)并在0℃下将反应混合物搅拌10分钟。向所得反应混合物中加入3-(2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(1.0g,3.30mmol)的N,N-二甲基甲酰胺的溶液,并将所得反应混合物在60℃下搅拌3小时。反应完成后,反应混合物用乙酸乙酯(15mL)稀释并用水(15mL)洗涤。分离乙酸乙酯层,用无水硫酸钠干燥,减压浓缩得到粗品。粗品通过硅胶快速柱色谱纯化,洗脱液为10%乙酸乙酯的己烷溶液,得到3-(2-((苯硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(1.03g,2.73mmol,产率83%)。¹H-NMR(400MHz,氯仿-D)δ8.39(t,1H),8.20-8.12(m,1H),7.49-7.45(m,1H),7.38-7.35(m,2H),7.29-7.24(m,3H),7.19-7.15(m,1H),4.36(s,2H);LCMS(M+H):377.35。

[0380] 表3:通过与化合物50类似的过程制备以下化合物

化合物编号	IUPAC 名称	分析数据
[0381] 46	3-(2-(((3-甲氧基苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR(400 MHz, 氯仿-D) δ 8.56-8.41 (m, 1H), 8.19-8.14 (m, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.52-7.48 (m, 1H), 7.22-7.17 (m, 1H), 7.01-6.93 (m, 2H), 6.78-6.71 (m, 1H), 4.38-4.34 (s, 2H), 3.77 (s, 3H); LCMS (M+H): 407.35.
47	3-(2-(((4-氯苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲	¹ H-NMR(400 MHz, 氯仿-D) δ 8.08-8.06 (m, 1H), 7.83 (dd, 1.0 Hz, 1H), 7.26 (d, 1H),

	基)-1,2,4-噁二唑	7.18-7.11 (m, 1H), 7.04-6.88 (m, 4H), 4.01 (s, 2H); LCMS (M+H): 410.85.
48	3-(2-(((4-氟苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿-D) δ 8.42 (t, 1H), 8.21-8.17 (m, 1H), 7.57-7.54 (m, 1H), 7.51 (dd, 1H), 7.42-7.37 (m, 2H), 7.03-6.97 (m, 2H), 4.30 (s, 2H); LCMS (M+H): 395.15.
49	3-(2-(((4-甲氧基苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿-D) δ 8.40 (d, 1H), 8.14 (dd, 1H), 7.52-7.45 (m, 2H), 7.37-7.33 (m, 2H), 6.84-6.80 (m, 2H), 4.25-4.23 (m, 2H), 3.78 (s, 3H); LCMS (M+H): 407.25.
51	3-(2-(((2-氟苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿-D) δ 8.38 (s, 1H), 8.14 (dd, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.48-7.37 (m, 2H), 7.24-7.18 (m, 1H), 7.09-7.02 (m, 2H), 4.35 (s, 2H); LCMS (M+H): 395.0.
52	5-(三氟甲基)-3-(2-(((4-(三氟甲基)苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿-D) δ 8.40 (s, 1H), 8.16 (dd, 1.0 Hz, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.51-7.42 (m, 5H), 4.41 (s, 2H); LCMS (M+H): 445.00.
53	3-(2-(((4-甲氧基苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿-D) δ 8.39 (s, 1H), 8.22-8.16 (m, 1H), 7.59 (s, 1H), 7.48 (dd, 1.7 Hz, 1H), 7.31-7.20 (m, 2H), 6.92-6.81 (m, 2H), 4.00-3.53 (m, 7H); LCMS (M+H): 421.05.
54	3-(2-((丙硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿-D) δ 8.39 (d, 1H), 8.19 (dd, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.52-7.47 (m, 1H), 3.92 (d, 2H), 2.60-2.57 (m, 2H), 1.66 (td, 7.3 Hz, 2H), 1.08-0.97 (m, 3H); LCMS (M+H): 343.00.

[0383] 实施例4:3-(2-((苯磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(化合物58)的制备

[0384] 在0℃下,向搅拌的3-(2-((苯硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(0.250g,0.664mmol)的二氯甲烷(10mL)溶液中,分批加入间氯过氧苯甲酸(0.573g,1.993mmol)并搅拌1小时,然后在25℃下搅拌8小时。反应混合物用二氯甲烷(20mL)稀释并用饱和碳酸氢钠水溶液(20mL)洗涤。分离有机层,用无水硫酸钠干燥,减压浓缩得到粗品。粗品通过硅胶快速柱色谱纯化,洗脱液为30%乙酸乙酯的己烷溶液,得到3-(2-((苯磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(0.156g,0.382mmol,产率58%)。¹H-NMR(400MHz,氯仿-D)δ8.31(t,1H),8.24(dd,1H),7.89(s,1H),7.83-7.80(m,2H),7.66-7.62(m,1H),7.57-7.49(m,3H),4.65(s,2H);LCMS(M+H):409.05。

[0385] 表4:通过与化合物58类似的过程制备以下化合物

化合物编号	IUPAC 名称	分析数据
55	3-(2-(((4-氯苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿-D) δ 8.32-8.24 (m, 2H), 8.05-7.89 (m, 1H), 7.72 (dt, 2H), 7.57-7.42 (m, 3H), 4.65 (s, 2H); LCMS (M+H): 442.95.
56	3-(2-(((4-甲氧基苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿-D) δ 8.33-8.23 (m, 2H), 7.89 (s, 1H), 7.73-7.70 (m, 2H), 7.53 (dd, 1H), 7.00-6.93 (m, 2H), 4.62 (s, 2H), 3.88 (s, 3H); LCMS (M+H): 438.95.
[0386] 57	3-(2-(((4-氟苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿-D) δ 8.31 (t, 1H), 8.25 (dd, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.82-7.77 (m, 2H), 7.58-7.40 (m, 1H), 7.19-7.14 (m, 2H), 4.65 (s, 2H); LCMS (M+H): 427.20.
59	3-(2-(((2-氟苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿-D) δ 8.30 (t, 1H), 8.21 (dd, 1.0 Hz, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.79-7.75 (m, 1H), 7.66-7.60 (m, 1H), 7.52-7.49 (m, 1H), 7.28-7.21 (m, 2H), 4.85 (s, 2H); LCMS (M+H): 427.50.
60	3-(2-(((4-甲氧基苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿-D) δ 8.48 (s, 1H), 8.31-8.23 (m, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.59-7.52 (m, 3H), 7.00-6.92 (m, 2H), 4.37 (s, 2H), 4.32 (s, 2H), 3.82 (s, 3H); LCMS (M+H): 453.50.
61	3-(2-((丙基磺酰基)甲基)咪唑并	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿-D) δ 8.42 (t, 1H),
[0387]	[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	8.25 (dd, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.56-7.52 (m, 1H), 4.52-4.47 (m, 2H), 3.13-3.04 (m, 2H), 2.03-1.89 (m, 2H), 1.14-1.06 (m, 3H); LCMS (M+H): 375.50.
62	5-(三氟甲基)-3-(2-(((4-(三氟甲基)苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿-D) δ 8.32 (s, 1H), 8.26 (dd, 1H), 7.97-7.92 (m, 3H), 7.77 (d, 2H), 7.57-7.52 (m, 1H), 4.70 (s, 2H); LCMS (M+H): 477.50.

[0388] 实施例5:N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺(化合物81)

[0389] 步骤1:3-(2-(叠氮甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二

唑

[0390] 在氮气氛下,向搅拌的3-(2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(2.70g,8.92mmol)的N,N-二甲基甲酰胺(25mL)溶液中加入叠氮化钠(0.638g,9.81mmol)。将所得反应混合物在25℃下搅拌16小时。将反应混合物倒入碎冰(50g)中并用乙酸乙酯(50mL)萃取两次。乙酸乙酯层用水(50mL)洗涤两次,无水硫酸钠干燥,减压浓缩得到3-(2-(叠氮甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(2.72g,8mmol,产率99%)。

[0391] 步骤2:(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲胺

[0392] 在0℃下,向3-(2-(叠氮甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(3.43g,11.09mmol)的四氢呋喃(30mL)溶液中加入三苯基膦(2.91g,11.1mmol),然后加入水(6mL),并将所得反应混合物在70℃下搅拌16小时。将反应混合物在减压下浓缩并将粗品与乙腈(25mL)共蒸发三次。在0℃下加入二氯甲烷(20mL)和盐酸的1,4-二噁烷(4mol)(13.87mL,55.5mmol)溶液并搅拌1小时。在减压下除去挥发物以获得粗品。在25℃下将粗品与60%乙酸乙酯的己烷(50mL)溶液搅拌并过滤以获得(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑[1,2-a]吡啶-2-基)甲胺(3.12g,11.02mmol,产率99%)。

[0393] 步骤3:N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺

[0394] 在0℃在氮气氛下,向搅拌的(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲胺(300mg,1.06mmol)的二氯甲烷(10mL)溶液中加入三乙胺(0.517mL,3.71mmol),然后将反应混合物搅拌10分钟。加入苯甲酸(194mg,1.589mmol)和1-[双(二甲氨基)亚甲基]-1H-1,2,3-三唑并[4,5-b]吡啶鎓3-氧化物六氟磷酸盐(1007mg,2.65mmol)并将所得反应混合物在25℃下搅拌16小时。反应混合物用二氯甲烷(25mL)萃取并用水(25mL)洗涤。二氯甲烷层用无水硫酸钠干燥,减压浓缩得到粗品。粗品通过硅胶柱色谱纯化,洗脱液为0-50%乙酸乙酯的己烷溶液,得到N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺(101mg,0.26mmol,产率25%)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ9.45-9.46(m,1H),9.09(t,1H),8.04(d,1H),7.89-7.92(m,2H),7.75(dd,1H),7.70(d,1H),7.52-7.56(m,1H),7.45-7.49(m,2H),4.61(d,2H),1.22(s,2H);LCMS(M);387.90。

[0395] 表5:通过与化合物81类似的过程制备以下化合物

[0396]

化合物编号	IUPAC 名称	分析数据
82	4-甲氧基-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.44 (q, 1H), 8.94 (t, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.89 (dd, 2H), 7.74 (dd, 1H), 7.69 (d, 1H), 6.98-7.01 (m, 2H), 4.58 (d, 2H), 3.80 (s, 3H), 1.22 (s, 3H); LCMS(M+1) = 418.05
83	4-氯-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.44 (q, 1H), 9.18 (t, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.92 (dd, 2H), 7.74 (dd, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.54-7.57 (m, 2H), 4.60 (d, 2H); LCMS(M) = 421.85
84	2-(4-氯苯基)-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)乙酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (q, 1H), 8.65 (t, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.76 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.34-7.36 (m, 2H), 7.30 (dd, 2H), 4.39 (d, 2H), 3.49 (s, 2H); LCMS(M+1) = 436.05
85	3-氯-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.45 (q, 1H), 9.23 (t, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.95 (t, 1H), 7.85-7.88 (m, 1H), 7.75 (dd, 1H), 7.70 (dd, 1H), 7.62 (dq, 1H), 7.52 (t, 1H), 4.61 (d, 2H); LCMS(M+1) = 422.05
86	3,4-二氯-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.44 (q, 1H), 9.30 (t, 1H), 8.14 (d, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.88 (dd, 1H), 7.74-7.79 (m, 2H), 7.70 (d, 1H), 4.60 (d, 2H); LCMS(M) = 456.00

[0397]

87	N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)吡啶酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.46 (q, 1H), 9.27 (t, 1H), 8.67 (dq, 1H), 8.07 (dt, 1H), 7.99-8.03 (m, 2H), 7.78 (dd, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.62 (ddd, 1H), 4.66 (d, 2H); LCMS(M+1) = 389.40
88	N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)丙酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.46 (q, 1H), 8.33 (t, 1H), 7.75 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 4.37 (d, 2H), 2.14 (q, 2H), 1.03 (t, 3H); LCMS(M+1) = 340.10
90	4-氟-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.44 (q, 1H), 9.13 (t, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.96-7.99 (m, 2H), 7.74 (dd, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.28-7.34 (m, 2H), 4.60 (d, 2H); LCMS(M)= 405.95
91	2-氟-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.49 (q, 1H), 8.89-8.91 (m, 1H), 8.04 (d, 1H), 7.65-7.76 (m, 3H), 7.51-7.57 (m, 1H), 7.27-7.33 (m, 2H), 4.60 (d, 2H); LCMS(M+1) = 406.10
92	N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)噁唑-4-甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.45 (q, 1H), 8.79 (t, 1H), 8.66 (d, 1H), 8.53 (d, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.74 (dd, , 1.7 Hz, 1H), 7.68-7.70 (m, 1H), 4.57 (d, 2H); LCMS(M) = 378.95
93	3-氟-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.44 (q, 1H), 9.20 (t, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.73-7.77 (m, 2H), 7.68-7.72 (m, 2H), 7.54 (td, 1H), 7.37-7.42 (m, 1H), 4.61 (d, 2H); LCMS(M+1) = 406.15
94	2-苯基-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)乙酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (q, 1H), 8.62 (t,1H), 7.97 (s, 1H), 7.75 (dd, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.27-7.30 (m, 4H), 7.19-7.24 (m, 1H), 4.39 (d, 2H), 3.48 (s, 2H); LCMS(M+1) = 402.15
95	4-(二甲基氨基)-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.45 (q, 1H), 8.71 (t, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.78 (d, 2H), 7.73 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 6.71 (d, 2H), 4.56 (d, 2H), 2.96

	基)苯甲酰胺	(s, 6H); LCMS(M+1) = 431.20
[0398]	96 3-甲基-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)丁酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.51 (q, 1H), 8.37 (t, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.76 (dd, 1H), 7.69 (d, 1H), 4.40 (d, 2H), 1.98-2.04 (m, 3H), 0.88-0.91 (m, 6H); LCMS(M+1) = 368.10
	97 4-(三氟甲基)-N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)苯甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.45 (q, 1H), 9.34 (t, 1H), 8.10 (d, 2H), 8.06 (s, 1H), 7.87 (d, 2H), 7.75 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 4.63 (d, 2H); LCMS(M) = 455.75
	98 N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)烟酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.44 (q, 1H), 9.31 (t, 1H), 9.06 (q, 1H), 8.71 (dd, 1H), 8.23 (dt, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.75 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.52 (ddd, 1H), 4.63 (d, 2H); LCMS(M) = 388.75
	99 N-((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)异烟酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.45 (q, 1H), 9.41 (t, 1H), 8.74 (dd, 2H), 8.06 (s, 1H), 7.80 (dd, 2H), 7.75 (dd, 1H), 7.69-7.71 (m, 1H), 4.62 (d, 2H); LCMS(M) = 388.75

[0399] 实施例6:3-(2-(((4-甲氧基苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑的制备(化合物100)

[0400] 步骤1:2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-甲腈

[0401] 在氮气氛围下,向搅拌的6-氨基烟腈(15g,126mmol)的乙醇(40mL)溶液中加入1,3-二氯丙-2-酮(63.9g,504mmol)并在60℃下搅拌16小时。反应完成后,将反应混合物倒入冰冷的碳酸氢钠饱和溶液(160mL)中,然后过滤得粗品2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-甲腈(20g,104mmol,产率83%)。

[0402] 步骤2:(Z)-2-(氯甲基)-N'-羟基咪唑并[1,2-a]吡啶-6-甲腈

[0403] 向搅拌的2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-甲腈(8.64g,45.1mmol)的乙醇(10mL)溶液中加入羟胺(4.47mL,67.6mmol)并在25℃下搅拌4小时。在减压下除去挥发物,获得(Z)-2-(氯甲基)-N'-羟基咪唑并[1,2-a]吡啶-6-甲腈(9.9g,44.1mmol,产率98%)和2-(乙氧基甲基)-N'-羟基咪唑并[1,2-a]吡啶-6-甲腈的混合物。

[0404] 步骤3:3-(2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑

[0405] 在0℃在氮气氛围下向搅拌的(Z)-2-(氯甲基)-N'-羟基咪唑并[1,2-a]吡啶-6-甲腈(2.3g,10.24mmol)和2-(乙氧基甲基)-N'-羟基咪唑并[1,2-a]吡啶-6-甲腈的四氢呋喃(12mL)溶液中加入三氟乙酸酐(1.848mL,13.09mmol)。将所得反应混合物在25℃下搅拌16小时。通过在0-5℃下倒入饱和碳酸氢钠水溶液(100mL)中来淬灭反应混合物。将产物萃取到乙酸乙酯(150mL)中。乙酸乙酯层用水(50mL)洗涤,无水硫酸钠干燥,减压浓缩得到粗品。粗品通过硅胶柱色谱纯化,洗脱液为0-50%乙酸乙酯的己烷溶液,得到3-(2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(3g,9.91mmol,产率97%)和2-(乙氧

基甲基)-N'-羟基咪唑并[1,2-a]吡啶-6-甲脒。¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆) δ 9.45 (q, 1H), 8.07 (d, 1H), 7.75 (dd, 1H), 7.68-7.70 (m, 1H), 4.58 (d, 2H), 3.56 (q, 2H), 1.15 (t, 3H); LCMS (M+1): 313.15。

[0406] 步骤4: 3-(2-(((4-甲氧基苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑

[0407] 向搅拌的4-甲氧基苯硫醇 (0.264mL, 2.148mmol) 的乙腈 (8mL) 溶液中加入碳酸钾 (457mg, 3.30mmol) 并在0℃下搅拌10分钟。然后加入3-(2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑 (500mg, 1.652mmol) 的N,N-二甲基甲酰胺溶液。将所得反应混合物在60℃搅拌3小时。反应混合物用乙酸乙酯 (15mL) 稀释并用水 (15mL) 洗涤。乙酸乙酯层用无水硫酸钠干燥并减压浓缩得到粗品。粗品通过硅胶快速柱色谱纯化, 洗脱液为20%的乙酸乙酯己烷溶液, 得到3-(2-(((4-甲氧基苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑 (244mg, 0.6mmol, 产率37%)。¹H-NMR (400MHz, 氯仿-D) δ 8.88-8.94 (m, 1H), 7.85 (dd, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.33-7.37 (m, 2H), 6.82 (dt, 2H), 4.21-4.23 (m, 2H), 3.78 (s, 3H); LCMS (M+1): 407.35。

[0408] 表6: 通过与化合物100类似的过程制备以下化合物

化合物编号	IUPAC 名称	分析数据
[0409] 101	3-(2-((苯基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.43 (q, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.67-7.70 (m, 1H), 7.37-7.40 (m, 2H), 7.27-7.32 (m, 2H), 7.14-7.19 (m, 1H), 4.37 (s, 2H); LCMS (M+1) = 377.40
102	3-(2-(((4-氯苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.42 (q, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.41 (dt, 2H), 7.35 (dt, 2H), 4.38 (s, 2H); LCMS (M+1) =

[0410]

	唑	411.20
103	3-(2-(((3-氯苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.43-9.45 (m, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.69 (dd, 1H), 7.48 (t, 1H), 7.34 (dt, 1H), 7.28-7.32 (m, 1H), 7.20-7.25 (m, 1H), 4.43 (s, 2H) ; LCMS (M) = 410.95
104	3-(2-(((3-氟苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.44 (q, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.75 (dd, 1H), 7.68-7.70 (m, 1H), 7.29-7.35 (m, 2H), 7.20 (dq, 1H), 6.95-7.00 (m, 1H), 4.43 (s, 2H) ; LCMS (M+1) = 395.35
105	3-(2-(((4-氟苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.42 (q, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.67-7.69 (m, 1H), 7.42-7.47 (m, 2H), 7.12-7.18 (m, 2H), 4.33 (s, 2H) ; LCMS (M+1) = 395.35
106	3-(2-(((2-氟苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.45 (q, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.76 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.56 (td, 1H), 7.16-7.30 (m, 3H), 4.40 (s, 2H) ; LCMS (M+1) = 395.35
107	3-(2-((丙硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.44 (q, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 3.81 (d, 2H), 2.52 (t, 2H), 1.56 (td, 2H), 0.91 (q, 3H) ; LCMS (M+1) = 343.35
108	3-(2-((苄硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.43 (q, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.69 (dd, 1H), 7.30-7.37 (m, 4H), 7.21-7.26 (m, 1H), 3.80 (s, 2H), 3.74 (s, 2H) ; LCMS (M+1) = 391.40
109	3-(2-(((4-甲氧基苄基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.43 (q, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.68-7.76 (m, 2H), 7.24-7.28 (m, 2H), 6.85-6.89 (m, 2H), 3.72-3.75 (m, 7H) ; LCMS (M+1) = 421.35
110	3-(2-(((3,4-二氯苄基)硫基)甲	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.44 (q, 1H),

	基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	8.06 (s, 1H), 7.75 (dd, 1H), 7.68-7.70 (m, 2H), 7.53 (d, 1H), 7.37 (dd, 1H), 4.45 (s, 2H); LCMS (M+1) = 444.90
111	3-(2-(((3,5-二氯苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.46 (q, 1H), 8.09 (d, 1H), 7.68-7.77 (m, 2H), 7.47-7.48 (m, 2H), 7.37 (t, 1H), 4.50 (s, 2H); LCMS (M+1) = 446.80
112	3-(2-((异丁基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.44 (q, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 3.82 (s, 2H), 2.44 (d, 2H), 1.74-1.81 (m, 1H), 0.93 (t, 6H); LCMS (M+1) = 357.50
[0411] 113	3-(2-((环戊基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.42-9.50 (m, 1H), 8.09 (d, 1H), 7.66-7.80 (m, 2H), 3.88 (d, 2H), 3.12-3.19 (m, 1H), 1.90-1.98 (m, 2H), 1.58-1.71 (m, 2H), 1.40-1.56 (m, 4H); LCMS (M+1) = 369.40
114	3-(2-((环己基硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.43 (q, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.73 (dd, 1H), 7.67 (d, 1H), 3.87 (s, 2H), 2.71-2.77 (m, 1H), 1.92-1.96 (m, 2H), 1.68 (d, 2H), 1.54 (d, 1H), 1.21-1.29 (m, 5H); LCMS (M+1) = 383.40
115	3-(2-(((2-乙基苯基)硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.43 (q, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.68-7.76 (m, 2H), 7.44-7.46 (m, 1H), 7.10-7.20 (m, 3H), 4.34 (s, 2H), 2.64 (q, 2H), 1.08-1.13 (m, 3H); LCMS (M+1) = 406.00

[0412] 实施例7:3-(2-((苯磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(化合物116)的制备

[0413] 在0℃下,向搅拌的3-(2-((苯硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(250mg,0.664mmol)的二氯甲烷(5mL)溶液中,加入间氯过氧苯甲酸(252mg,1.461mmol)并在25℃下搅拌16小时。反应完成后,反应混合物用二氯甲烷(20mL)稀释并用碳酸氢钠饱和溶液(20mL)洗涤。二氯甲烷层用无水硫酸钠干燥,减压浓缩得到粗品。粗品通过硅胶快速柱色谱纯化,洗脱液为30%的乙酸乙酯己烷溶液,得到3-(2-((苯磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(135mg,0.331mmol,产率50%)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-*d*₆) δ 9.49 (q, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.75-7.78 (m, 2H), 7.66-7.73 (m, 2H), 7.63 (d, 1H), 7.54-7.58 (m, 2H), 4.80-4.90 (m, 2H); LCMS (M+1): 409.05。

[0414] 表7:通过与化合物116类似的过程制备以下化合物

[0415]

化合物编号	IUPAC 名称	分析数据
117	3-(2-(((3,4-二氯苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.52 (q, 1H), 8.09 (s, 1H), 8.04 (d, 1H), 7.85-7.88 (m, 1H), 7.75-7.79 (m, 1H), 7.66-7.71 (m, 2H), 5.01 (s, 2H); LCMS (M+1) = 476.80
118	3-(2-(((3-氯苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.52 (q, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.84 (t, 1H), 7.80 (dq, 1H), 7.76 (dd, 1H), 7.71-7.74 (m, 1H), 7.69-7.69 (0H), 7.66 (d, 1H), 7.61 (t, 1H), 4.97 (s, 2H); LCMS (M+1) = 443.00
119	3-(2-(((4-氯苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.52 (q, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.74-7.80 (m, 3H), 7.66-7.69 (m, 3H), 4.92 (s, 2H); LCMS (M+1) = 444.00
120	3-(2-(((3-氟苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.52 (q, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.74-7.78 (m, 1H), 7.57-7.69 (m, 5H), 4.96 (s, 2H); LCMS (M+1) = 427.30
121	3-(2-(((4-氟苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.51 (q, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.82-7.86 (m, 2H), 7.75 (dd, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.40-7.46 (m, 2H), 4.89 (s, 2H); LCMS (M+1) = 427.20
122	3-(2-(((4-甲氧基苄基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.56 (t, 1H), 8.23 (s, 1H), 7.82 (dd, 2H), 7.40 (dt, 2H), 6.96 (dt, 2H), 4.57 (s, 2H), 4.52 (s, 2H), 3.75 (s, 3H); LCMS (M+1) = 453.25

[0416]

123	3-(2-((环己基磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.55 (t, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.75-7.81 (m, 2H), 4.63 (s, 2H), 3.16 (tt, 1H), 2.14 (d, 2H), 1.82 (d, 2H), 1.64 (d, 1H), 1.41 (qd, 2H), 1.14-1.31 (m, 3H); LCMS (M+1) = 415.50
124	3-(2-(((2-氟苯基)磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.57 (q, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.87 (dd, 1H), 7.77-7.83 (m, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.68 (td, 1H), 7.53 (ddd, 1H), 7.37 (td, 1H), 5.03 (s, 2H); LCMS (M+1) = 426.90
126	3-(2-(((3,4-二氯苯基)亚磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.52 (d, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.75-7.81 (m, 3H), 7.68 (d, 1H), 7.55 (dd, 1H), 4.50 (d, 1H), 4.36 (d, 1H); LCMS (M+1) = 460.75
127	3-(2-(((3-氯苯基)亚磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.51 (q, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.77 (dd, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.64 (q, 1H), 7.54-7.61 (m, 3H), 4.46 (d, 1H), 4.33 (d, 1H); LCMS (M) = 426.85
128	3-(2-(((2-氟苯基)亚磺酰基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.50 (q, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.76 (dd, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.58-7.62 (m, 2H), 7.33-7.42 (m, 2H), 4.46 (d, 1H), 4.34 (d, 1H); LCMS (M+1) = 411.25

[0417] 实施例8:N-(甲基(氧代)(苯基)-λ⁶-亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺(化合物129)的制备

[0418] 步骤1:2-(6-氰基咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯

[0419] 向搅拌的6-氨基烟腈(7g, 58.8mmol)的乙醇(70mL)溶液中加入4-氯-3-氧代丁酸乙酯(19.98mL, 147mmol)并在60℃下搅拌48小时。将反应混合物在25℃下搅拌1小时,然后过滤得到纯产物。将产物与饱和碳酸氢钠溶液(50mL)一起搅拌,然后过滤得到2-(6-氰基咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯(11g, 41.4mmol, 产率71%)。

[0420] 步骤2:2-(6-(N'-羟基甲脒基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯

[0421] 在25℃下,向搅拌的2-(6-氰基咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯(9.1g, 39.7mmol)的乙醇(100mL)溶液中加入羟胺(6.50mL, 119mmol),并将所得反应混合物在25℃下搅拌4小时。在减压下除去挥发物以获得粗品2-(6-(N'-羟基甲脒基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯(10.1g, 38.5mmol, 产率97%)。

[0422] 步骤3:2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯在0℃在氮气氛下,向搅拌的2-(6-(N'-羟基甲脒基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯(10.1g, 38.5mmol)和四氢呋喃(100mL)的溶液中加入三氟乙酸酐(7.62mL, 53.9mmol),并将反应混合物在25℃下搅拌16小时。通过在0-5℃下倒入饱和碳酸氢钠水溶液(100mL)中

来淬灭反应混合物。将产物萃取到乙酸乙酯(150mL)中。乙酸乙酯层用水(50mL)洗涤,无水硫酸钠干燥,减压浓缩得到2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基))咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯(10.52g,30.9mmol,产率80%)。

[0423] 步骤4:N-(甲基(氧代)(苯基)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺

[0424] 在0-5°C下,向搅拌的亚氨基(甲基)(苯基)- λ^6 -亚砷(imino(methyl)(phenyl)- λ^6 -sulfanone)(205mg,1.323mmol)的甲苯(7mL)溶液中加入25%的三甲基铝的己烷溶液(0.636mL,2.204mmol)中并在25°C搅拌30分钟。然后在氮气氛下加入2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酸乙酯(300mg,0.882mmol)。将所得反应混合物在65°C搅拌16小时。将反应混合物冷却至25°C并倒入10%乙酸水溶液(10mL)的冰冷溶液中。产物用乙酸乙酯(30mL)萃取。乙酸乙酯层用碳酸氢钠水溶液(10mL)洗涤,无水硫酸钠干燥,减压浓缩得到粗品。粗品经制备型HPLC纯化得到N-(甲基(氧代)(苯基)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺(N-(methyl(oxo)(phenyl)- λ^6 -sulfanylidene)-2-(6-(5-(trifluoromethyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl)imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)acetamide)(112mg,0.25mmol,产率28%)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ 9.45(q,1H),8.03(s,1H),7.95-7.97(m,2H),7.71-7.75(m,2H),7.63-7.68(m,3H),3.77(s,2H),3.43(d,3H):LCMS(M+1):450.40.。

[0425] 表8:通过使用与化合物129类似的过程制备以下化合物

化合物编号	IUPAC 名称	分析数据
[0426] 130	N-((2-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.44 (q 1H), 8.01 (s, 1H), 7.94 (td, 1H), 7.78-7.83 (m, 1H), 7.72 (dd 1H), 7.66 (d, 1H), 7.47-7.53 (m, 2H),

[0427]

	并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	3.75 (d, 2H), 3.52 (s, 3H); LCMS (M+1): 468.40
131	N-((3-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.47 (q, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.81-7.85 (m, 2H), 7.71-7.77 (m, 2H), 7.68 (d, 1H), 7.60-7.65 (m, 1H), 3.75-3.88 (m, 2H), 3.51 (s, 3H); LCMS (M+1): 468.40
132	N-((4-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.45 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 8.03-8.06 (m, 3H), 7.73 (dd, J = 9.4, 1.8 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.48-7.54 (m, 2H), 3.77 (dd, J = 18.0, 16.5 Hz, 2H), 3.48 (s, 3H); LCMS(M+1):468.00
133	N-((3-甲氧基苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.47 (q, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.75 (dd, 1.8 Hz, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.58 (t, 1H), 7.54 (dt, 1H), 7.42 (t,1H), 7.29 (dq, 1H), 3.83 (t, 3H), 3.78 (d, 2H), 3.47 (s, 3H); LCMS (M+1): 480
134	N-(二甲基(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.46 (q, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.66-7.69 (m, 1H), 3.71 (s, 2H), 3.35 (s, 6H); LCMS (M+1): 388
135	N-(1-氧代四氢-2H-1 λ^6 -硫代吡喃-1-亚基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.46 (q, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.72 (dd, 1H), 7.66 (d, 1H), 3.72 (s, 2H), 3.54-3.59 (m, 2H), 3.34-3.38 (m, 2H), 1.90-1.97 (m, 2H), 1.78-1.87 (m, 2H), 1.50-1.59 (m, 2H); LCMS (M+1): 428.05
136	N-((4-氯苯基)(2-甲氧基乙基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.46 (q, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.91-7.96 (m, 2H), 7.68-7.74 (m, 4H), 3.85-3.96 (m, 2H), 3.79 (dd, 2H), 3.55-3.67 (m, 2H), 2.99 (s, 3H); LCMS (M+1): 528

[0428]

137	N-(异丙基(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.48 (q, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.73 (dd, 1H), 7.67 (d, 1H), 3.72 (s, 2H), 3.64 (td, 1H), 3.30 (d, 3H), 1.24-1.44 (m, 6H); LCMS (M+1): 415.75
138	N-((4-甲氧基苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.45-9.47 (m, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.87-7.90 (m, 2H), 7.66-7.74 (m, 2H), 7.14-7.18 (m, 2H), 3.84 (d, 3H), 3.76 (t, 2H), 3.43 (s, 3H); LCMS (M+1): 480.05
139	N-(甲基(氧代)(4-(三氟甲基)苯基)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.44 (t, 1H), 8.19 (d, 2H), 8.04 (t, 3H), 7.73 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 3.78 (d, 2H), 3.52 (s, 3H); LCMS (M+1): 518.00
140	N-((3,5-二氯苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.44 (q, 1H), 8.03 (t, 2H), 7.95 (d, 2H), 7.74 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 3.76 (dd, Hz, 2H), 3.53 (s, 3H); LCMS (M-1): 517.70
141	N-(1-氧代四氢-1 λ^6 -硫代苯-1-亚基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.46 (s, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.72 (dd, 1H), 7.66 (d, 1H), 3.71 (d, 2H), 3.47-3.54 (m, 2H), 3.16 (d, 2H), 2.15-2.24 (m, 2H), 2.06-2.11 (m, 2H); LCMS (M+1): 413.95
142	N-((4-溴苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.46 (q, 1H), 8.06 (d, 1H), 7.88-7.93 (m, 4H), 7.75 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 3.78 (dd, 16.6 Hz, 2H), 3.49 (s, 3H); LCMS (M-1): 527.70
143	N-((3,4-二氯苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.46 (q, 1H), 8.17 (d, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.95-7.96 (m, 2H), 7.75 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 3.81 (d, 1H), 3.74 (d, 1H), 3.53 (s, 3H) - LCMS (M-1): 517.70
144	N-(4-氧代-1,4 λ^6 -噁嗪-4-亚	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.46 (q, 1H),

	基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	8.06 (s, 1H), 7.73 (dd, 1H), 7.66 (d, 1H), 4.08 (td, 2H), 3.81-3.87 (m, 2H), 3.76 (s, 2H), 3.70 (dt, 2H), 3.45-3.52 (m, 2H); LCMS (M+1): 429.95
145	N-((2-甲氧基苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.45 (q, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.86 (dd, 1H), 7.64-7.73 (m, 3H), 7.28 (d, 1H), 7.16-7.20 (m, 1H), 3.87 (d, 3H), 3.69 (s, 2H), 3.45 (s, 3H); LCMS (M+1): 480
146	N-((4-甲氧基吡啶-2-基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.44 (q, 1H), 8.58 (d, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.72 (dd, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.30 (q, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.74 (d, 2H), 3.44 (s, 3H); LCMS (M+1): 481.05
[0429] 147	N-((4-氯苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.45 (q, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.98 (dt, 2H), 7.71-7.76 (m, 3H), 7.68 (d, 1H), 3.76 (dd, 2H), 3.48 (s, 3H); LCMS(M+1): 483.95
148	N-(甲基(氧代)(邻甲苯基)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.44 (q, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.94 (dd, 1.2 Hz, 1H), 7.72 (dd, 1.7 Hz, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.59 (td, 1H), 7.45 (q, 2H), 3.76 (s, 2H), 3.43 (s, 3H), 2.54 (s, 3H); LCMS(M+1): 464.45
149	N-((3-氯苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)-2-(6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)乙酰胺	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.44 (q, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.97 (t, 1H), 7.92 (dq, 1H), 7.80 (dq, 1H), 7.72-7.74 (m, 1H), 7.66-7.70 (m, 2H), 3.70-3.83 (m, 2H), 3.50 (s, 3H); LCMS(M+1): 484.05

[0430] 实施例9: N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺(化合物155)的制备

[0431] 步骤1: 2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈

[0432] 向搅拌的2-氨基异烟腈(20g, 168mmol)的乙醇(100mL)溶液中加入1,3-二氯丙-2-酮(38.4g, 302mmol)并在50℃下搅拌16小时。反应混合物用饱和碳酸氢钠水溶液淬灭, 所得沉淀物通过布氏漏斗过滤并用最少量乙醇洗涤以除去未反应的原料。所得残余物为2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈(21g, 110mmol, 产率65%)。

[0433] 步骤2: 2-((甲硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈

[0434] 在0℃下, 向搅拌的2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈(1.0g, 5.22mmol)的四氢呋喃(20mL)溶液中分批缓慢加入甲硫醇钠(0.439g, 6.26mmol), 并在25℃下进一步搅拌8

小时。所得反应混合物用水淬灭,用乙酸乙酯(20mL)萃取两次,用盐水(20mL)洗涤两次,用硫酸钠干燥并减压浓缩。粗品通过硅胶快速柱色谱纯化,洗脱液为20%乙酸乙酯的己烷溶液,得到2-((甲硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈(0.98g,4.82mmol,产率92%)。

[0435] 步骤3:N'-羟基-2-((甲硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈

[0436] N'-羟基-2-((甲硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈的合成实验过程类似于实施例8的步骤2(7.8g,33.0mmol,产率96%)。

[0437] 步骤4:3-(2-((甲硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑

[0438] 3-(2-((甲硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑的合成实验步骤与实施例8的步骤3类似(8.25g,26.2mmol,产率86%)。

[0439] 步骤5:亚氨基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜

[0440] 在0℃下,向搅拌的3-(2-((甲硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(8.5g,27.0mmol)和氨基甲酸铵(5.28g,67.6mmol)的甲醇(50mL)溶液中,缓慢分批加入二乙酸碘苯(21.78g,67.6mmol)并在25℃下搅拌12小时。减压浓缩所得反应混合物。所得粗残余物用乙酸乙酯(50mL)稀释且溶液用碳酸氢钠(80mL)溶液中和。收集乙酸乙酯层并用乙酸乙酯(50mL)萃取水层三次。合并的乙酸乙酯层用无水硫酸钠干燥并减压浓缩。粗残留物通过硅胶快速柱色谱纯化,洗脱液为10%的甲醇的二氯甲烷溶液,得到亚氨基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜(4.8g,13.90mmol,产率51%)。

[0441] 步骤6:N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺

[0442] 在0℃下,向搅拌的亚氨基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砜(0.2g,0.579mmol)和4-二甲氨基吡啶(0.014g,0.116mmol)的溶液加入三甲胺(0.109mL,1.158mmol)和二氯甲烷(10mL),然后加入苯甲酰氯(0.122g,0.869mmol)并在25℃下搅拌3小时。所得反应混合物用水稀释,用乙酸乙酯(20mL)萃取两次,用盐水(20mL)洗涤两次,用硫酸钠干燥并减压浓缩。所得粗品通过硅胶快速柱色谱纯化,洗脱液为80%的乙酸乙酯的己烷溶液,得到N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺(0.124g,0.276mmol,产率48%)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ 8.83-8.30(m,1H),8.32(s,1H),8.27-8.25(m,1H),8.00-7.98(m,2H),7.57-7.51(m,2H),7.46-7.42(m,2H),5.29-5.11(m,2H),3.51(s,3H);¹⁹F-NMR(377MHz,氯仿-D) δ -64.67;LCMS(M+H):449.95。

[0443] 表9:通过与化合物155类似的过程制备以下化合物

[0444]

化合物编号	IUPAC 名称	分析数据
152	亚氨基(甲基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砷	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.78 (dd, 1H), 8.20 (q 2H), 7.49 (dd, 1H), 4.57 (dd, 2H), 3.73 (s, 1H), 2.96 (s, 3H); $^{19}\text{F-NMR}$ (377 MHz, 氯仿-D) δ -64.68; LCMS (M+H): 345.95.
153	N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)新戊酰胺	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.82 (dd, 1H), 8.22-8.19 (m, 2H), 7.51 (dd, 1H), 5.08 (s, 2H), 3.32 (s, 3H), 0.98 (s, 9H); $^{19}\text{F-NMR}$ (377 MHz, 氯仿-D) δ -64.58; LCMS (M+H): 430.05.
154	4-甲氧基-N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.82-8.78 (m, 1H), 8.28 (s, 1H), 8.25-8.23 (m, 1H), 7.93 (dt, 2H), 7.50 (dd, 1H), 6.95 (dt, 2H), 5.21 (t, 2H), 3.79 (s, 3H), 3.46 (s, 3H); $^{19}\text{F-NMR}$ (377 MHz, 氯仿-D) δ -64.58; LCMS (M+H): 479.80.
156	4-氯-2-氟-N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.80 (dd, 1H), 8.28 (s, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.82 (t, 1H), 7.51 (dd, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.33-7.30 (m, 1H), 5.24 (s, 2H), 3.48 (s, 3H); $^{19}\text{F-NMR}$ (377 MHz, 氯仿-D) δ -64.58, -109.05; LCMS (M+H): 501.95.
157	3-氟-N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.80 (dd, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.80 (dt, 1H), 7.66 (dq,

	噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺	¹ H), 7.52-7.46 (m, 2H), 7.41-7.36 (m, 1H), 5.25 (dd, 2H), 3.51 (s, 3H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, 氯仿-D) δ -64.58, -113.12; LCMS (M+H): 467.95.
158	3-氯-N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.79 (dd, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.23 (s, 1H), 7.92-7.89 (m, 2H), 7.61 (dt, 1H), 7.52-7.45 (m, 2H), 5.26 (dd, 2H), 3.51 (s, 3H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, 氯仿-D) δ -64.58; LCMS (M+H): 483.95.
159	4-氯-N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.82-8.78 (m, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.24 (d, 1H), 7.98-7.95 (m, 2H), 7.53-7.48 (m, 3H), 5.25 (dd, 2H), 3.50 (s, 3H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, 氯仿-D) δ -64.58; LCMS (M+H): 484.00.
[0445]	160 N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)-4-(三氟甲氧基)苯甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.81 (dd, 1H), 8.32 (s, 1H), 8.24 (t, 1H), 8.11-8.08 (m, 2H), 7.52 (dd, 1H), 7.43 (dd, 2H), 5.27 (s, 2H), 3.52 (s, 3H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, 氯仿-D) δ -56.60, -64.68; LCMS (M+H): 534.
	161 N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)-2-(三氟甲基)苯甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.82 (dd, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.25 (d, 1H), 7.74-7.72 (m, 1H), 7.69-7.58 (m, 3H), 7.52 (dd, 1H), 5.25 (dd, 2H), 3.48 (s, 3H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, 氯仿-D) δ -57.31, -64.58; LCMS (M+H): 517.95
	162 N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)-3-(三氟甲基)苯甲酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.79 (dd, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.22-8.24 (m, 3H), 7.91 (d, 1H), 7.70 (t, 1H), 7.51 (dd, 1H), 5.28 (dd, 2H), 3.54 (s, 3H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ -61.22, -64.68; LCMS (M-H): 516
	163 2-氟-N-(甲基(氧代)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.80 (dd, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.77 (td, 1H), 7.48-7.54 (m, 2H), 7.18-7.22 (m, 2H), 5.22 (d, 2H), 3.48 (s,
[0446]	吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚硫基)苯甲酰胺	3H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ -64.67, -112.36; LCMS (M+H): 468.00

[0447] 实施例10: 亚氨基(苯基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砷的制备(化合物164)

[0448] 步骤1:2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈

[0449] 向搅拌的2-氨基异烟腈(20g,168mmol)的乙醇(100mL)溶液中加入1,3-二氯丙-2-酮(38.4g,302mmol)并在50℃下搅拌16小时。反应混合物用饱和碳酸氢钠水溶液(500mL)淬灭,所得沉淀物经布氏漏斗过滤,所得固体用乙醇(50mL)洗涤。将所得残余物在减压下干燥以获得2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈(21g,110mmol,产率65%)。

[0450] 步骤2:2-(氯甲基)-N'-羟基咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈

[0451] 在25℃下,向搅拌的2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈(10.25g,53.5mmol)的乙醇(50mL)溶液中加入50wt.%羟胺水溶液(6.56mL,107mmol)。将所得反应混合物在60℃下搅拌3小时并减压浓缩,得到2-(氯甲基)-N'-羟基咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈(11.54g,53.5mmol,产率96%)。

[0452] 步骤3:3-(2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑

[0453] 在0-5℃在氮气氛下,向搅拌的2-(氯甲基)-N'-羟基咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲腈(12.0g,53.4mmol)的四氢呋喃(50mL)溶液中缓慢加入三氟乙酸酐(13.58mL,96mmol),并在25℃下搅拌18小时。在减压下浓缩所得混合物并将所得残余物溶解在二氯甲烷(100mL)中。二氯甲烷层用碳酸氢钠水溶液(50mL)洗涤,然后用盐水(50mL)洗涤,经无水硫酸钠干燥并减压浓缩。粗品通过硅胶快速柱色谱纯化,洗脱液为60%的乙酸乙酯的己烷溶液,得到3-(2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(12.56g,41.5mmol,产率78%)。

[0454] 步骤4:3-(2-((苯硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑

[0455] 在氮气氛下,向搅拌的苯硫醇(0.473g,4.30mmol)的乙腈(8mL)溶液中加入碳酸钾(0.91g,6.6mmol)并将反应混合物在0℃下搅拌10分钟。向所得反应混合物中加入3-(2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(1.0g,3.30mmol)的N,N-二甲基甲酰胺溶液,并将所得反应混合物在60℃下搅拌3小时。反应完成后,反应混合物用乙酸乙酯(15mL)稀释并用水(15mL)洗涤。分离乙酸乙酯层,用无水硫酸钠干燥,减压浓缩得到粗品。粗品通过硅胶快速柱色谱纯化,洗脱液为10%的乙酸乙酯的己烷溶液,得到3-(2-((苯硫基)甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(1.03g,2.73mmol,产率83%)。¹H-NMR(400MHz,氯仿-D) δ8.39(t,1H),8.20-8.12(m,1H),7.49-7.45(m,1H),7.38-7.35(m,2H),7.29-7.24(m,3H),7.19-7.15(m,1H),4.36(s,2H);LCMS(M+H):377.35。

[0456] 步骤5:亚氨基(苯基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)-λ⁶-亚砷

[0457] 合成亚氨基(苯基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)-λ⁶-亚砷的实验过程类似于实施例9的步骤5(0.132g,31%)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ8.76(dd,1H),8.08-8.06(m,2H),7.80-7.77(m,2H),7.65-7.61(m,1H),7.53(td,2H),7.46(dd,1H),4.68(dd,2H),4.41(s,1H);¹⁹F-NMR(377MHz,氯仿-D) δ-64.68;LCMS(M+H):407.85。

[0458] 表10:通过类似于化合物164的过程制备以下化合物

化合物编号	IUPAC 名称	分析数据
165	亚氨基(4-甲氧基苯基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砷	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.76 (dd, 1H), 8.10 (t, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.71-7.67 (m, 2H), 7.46 (dd, 1H), 7.06-7.02 (m, 2H), 4.63 (dd, 2H), 4.26 (s, 1H), 3.81 (s, 3H); $^{19}\text{F-NMR}$ (377 MHz, 氯仿-D) δ -64.68; LCMS (M+H): 438.05
[0459] 166	(4-氯苯基)(亚氨基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砷	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.76 (dd, 1H), 8.09-8.07 (m, 2H), 7.76 (dt, 2H), 7.60 (dt, 2H), 7.46 (dd, 1H), 4.71 (dd, 2H), 4.54 (s, 1H); $^{19}\text{F-NMR}$ (377 MHz, 氯仿-D) δ -64.67; LCMS (M+H): 441.70
167	(4-氟苯基)(亚氨基)((7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)- λ^6 -亚砷	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.78-8.76 (m, 1H), 8.07 (d, 2H), 7.82-7.78 (m, 2H), 7.46 (dd, 1H), 7.38-7.33 (m, 2H), 4.70 (dd, 2H), 4.50 (s, 1H); $^{19}\text{F-NMR}$ (377 MHz, 氯仿-D) δ -64.58, -107.05; LCMS (M+H): 425.85

[0460] 实施例11: (3-氟苯基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷(化合物168)的制备

[0461] 步骤1: 6-(5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-醛

[0462] 在-78℃下,向搅拌的6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酸乙酯(3.5g, 10.73mmol)的二氯甲烷(150mL)溶液,滴加DIBAL-H(37.5mL, 37.5mmol)并在相同温度下再搅拌30分钟。反应混合物用10%乙酸(250mL)淬灭并用二氯甲烷(150mL)萃取三次。将合并的有机层进一步用盐水(100mL)洗涤两次,用硫酸钠干燥并在减压下蒸发至干以获得6-(5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-醛(3.0g, 10.56mmol, 产率98%)。该粗品原样用于下一步。

[0463] 步骤2: 6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-醛

[0464] 在0℃下,向搅拌的6-(5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-醛(3g, 10.56mmol)的二氯甲烷(15mL)溶液中加入2,3-二氯-5,6-二氰基-1,4-苯醌(1.198g, 5.28mmol),并在25℃下进一步搅拌30分钟。反应完成后,反应混合物用饱和碳酸氢钠(100mL)淬灭并用乙酸乙酯(100mL)萃取三次。合并的有机层用盐水(50mL)洗涤两次,用硫酸钠干燥并蒸发至干。通过combi flash纯化获得的粗品,在20%的乙酸乙酯的己烷溶液中洗脱所需化合物以提供6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-醛(1.5g, 5.32mmol, 两步产率50%),为白色固体。

[0465] 步骤3: (3-氟苯基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷

[0466] 向搅拌的6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-醛(0.3g,1.063mmol)在甲酸中的溶液(3mL)溶液中,加入(3-氟苯基)(亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砷(0.331g,1.914mmol)。将所得混合物在微波中在130°C下辐照1小时。反应完成后,将反应混合物倒在冷的饱和碳酸氢钠(200mL)上并用乙酸乙酯(100mL)萃取三次。合并的有机层用盐水(100mL)洗涤两次,用硫酸钠干燥并真空蒸发至干。通过制备型HPLC纯化粗化合物,获得(3-氟苯基)(甲基)((6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶)-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷(0.017g,0.039mmol,产率3.6%)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ 9.42(q,1H),8.02(s,1H),7.76(dt,1H),7.65-7.72(m,3H),7.62(d,1H),7.51-7.56(m,1H),4.17(d,1H),4.02(d,1H),3.28(s,3H);LCMS(M+1):440.5。

[0467] 表11:通过类似于化合物168的过程制备以下化合物

化合物编号	IUPAC 名称	分析数据
[0468] 169	乙基(甲基)((6-(5-(三氟甲	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.42 (s, 1H),
[0469]	基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)甲基)亚氨基)- λ^6 -亚砷	7.99 (s, 1H), 7.71 (dd, 1H), 7.64 (d, 1H), 4.27 (s, 2H), 3.16-3.22 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 1.22-1.27 (m, 3H); LCMS (M+1): 374.00

[0470] 实施例12: (3-氟苯基)(甲基)((2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷(化合物170)的制备

[0471] 步骤1: 3-(((3-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)氨基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-6-甲脒

[0472] 在0°C在氮气氛下,向(3-氟苯基)(亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砷的二甲基亚砷(2mL)溶液中加入氢氧化钾(0.097g,1.732mmol)并在25°C下搅拌15分钟。加入2-(氯甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-甲脒(0.266g,1.386mmol)在1mL二甲基亚砷中的溶液,并将所得反应混合物在25°C下搅拌10分钟。反应混合物用饱和氯化铵水溶液(20mL)淬灭并用二氯甲烷(100mL)萃取两次。合并的二氯甲烷层用盐水(25mL)洗涤两次,用无水硫酸钠干燥并在减压下浓缩,获得3-(((3-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)氨基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-6-甲脒(0.09g,0.274mmol,产率16%)。

[0473] 步骤2: 3-(((3-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)氨基)-N'-羟基-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-6-甲脒

[0474] 在0°C在氮气氛下,向3-(((3-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)氨基)-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-6-甲脒(0.22g,0.670mmol)的甲醇(5mL)溶液中加入羟胺(0.111mL,2.010mmol)。将反应混合物在25°C搅拌16小时。减压浓缩反应混合物,与乙酸乙酯共蒸馏两次,得到3-(((3-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)氨基)-N'-羟基-2-甲基咪唑[1,2-a]吡啶-6-甲脒(0.22g,0.610mmol,产率91%)。粗品原样用于下一步中。

[0475] 步骤3: (3-氟苯基)(甲基)((2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砷

[0476] 在0°C和氮气氛下,向搅拌的3-(((3-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)氨基)-

N'-羟基-2-甲基咪唑并[1,2-a]吡啶-6-甲脒(0.22g,0.610mmol)的四氢呋喃(5mL)溶液中加入三氟乙酸酐(0.172mL,1.221mmol)。将所得反应混合物在25℃搅拌16小时。将反应混合物倒入冰冷的碳酸氢钠饱和溶液(25mL)中并用乙酸乙酯(50mL)萃取两次。有机层用无水硫酸钠干燥并浓缩,得到粗品(150mg)。通过combiflash纯化粗品,获得120mg含有捕获乙酸的所需化合物。然后将物质溶于四氢呋喃,加入碳酸钾(50mg),25℃搅拌1小时,过滤蒸发至干得(3-氟苯基)(甲基)((2-甲基-6-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜(0.061g,0.139mmol,产率23%)。¹H-NMR(400MHz,氯仿-D) δ 8.98(q,1H),7.79(dq,1H),7.72(dt,1H),7.66(dd,1H),7.56(td,1H),7.48(dd,1H),7.33-7.37(m,1H),3.41(s,3H),2.31-2.33(m,3H),;LCMS(M+1):440.05。

[0477] 实施例13:制备(2-氟苯基)(甲基)((2-(三氟甲基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶)-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜(化合物171)

[0478] 步骤a:2-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲脒

[0479] 向搅拌的2-氨基异烟脒(10g,84mmol)的乙醇(50mL)溶液中加入3-溴-1,1,1-三氟丙-2-酮(13.1mL,126mmol)并在100℃搅拌24小时。用饱和碳酸氢钠水溶液(70mL)淬灭反应;所得沉淀物通过布氏漏斗过滤并用乙醇(10mL)洗涤以除去未反应的原料。将所得残余物在空气抽吸下干燥以获得2-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲脒(9.1g,43mmol,产率51%)。

[0480] 步骤b:3-溴-2-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲脒

[0481] 在0℃下,向搅拌的2-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲脒(3g,14.21mmol)的二氯甲烷(20mL)溶液中加入N-溴代琥珀酰亚胺(2.78g,15.63mmol)并在25℃下进一步搅拌15分钟。反应完成后,将反应用饱和碳酸氢钠水溶液(70mL)淬灭并用乙酸乙酯(50mL)萃取两次。乙酸乙酯层用盐水溶液(25mL)洗涤两次,用无水硫酸钠干燥并减压蒸发得到3-溴-2-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲脒(4g,13.8mmol,产率97%)。

[0482] 步骤c:3-(((2-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)氨基)-2-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲脒

[0483] 在25℃下,向搅拌的3-溴-2-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲脒(0.2g,0.7mmol)和(2-氟苯基)(亚氨基)(甲基)- λ^6 -亚砜(0.13g,0.76mmol)的甲苯(8mL)溶液中加入碳酸铯(0.52g,1.59mmol),然后加入(2,2'-双(二苯基膦)-1,1'-联萘)(0.021g,0.034mmol)和醋酸钨(II)(1.55mg,6.9 μ mol)。所得反应混合物用氮气吹扫2分钟并在110℃下搅拌16小时。将反应混合物冷却至25℃并通过硅藻土垫过滤。滤饼用乙酸乙酯(20mL)洗涤。滤液用水(5mL)和盐水溶液(5mL)洗涤。乙酸乙酯层用无水硫酸钠干燥并减压浓缩。所得残余物通过快速色谱纯化,得到3-(((2-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)氨基)-2-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲脒(0.16g,0.42mmol,产率61%)。

[0484] 步骤d:3-(((2-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)氨基)-N'-羟基-2-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲脒

[0485] 向搅拌的3-(((2-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)氨基)-2-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲脒(0.3g,0.78mmol)的乙醇(15mL)溶液中,加入羟胺水溶液(50%)(0.24mL,3.92mmol)。将所得反应混合物在60℃下搅拌4小时。减压除去挥发物,所得残余物与甲苯(10mL)共蒸发,获得3-(((2-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)氨基)-N'-羟基-2-

(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲脒(0.2g,0.48mmol,产率61%)。

[0486] 步骤e: (2-氟苯基)(甲基)((2-(三氟甲基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜

[0487] 在5°C下,向搅拌的3-(((2-氟苯基)(甲基)(氧代)- λ^6 -亚硫基)氨基)-N'-羟基-2-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-7-甲脒(0.2g,0.48mmol)的四氢呋喃(2mL)溶液中滴加三氟乙酸酐(0.1mL,0.72mmol)30分钟。使所得反应混合物升温至25°C并搅拌16小时。反应混合物用碳酸氢钠溶液(2mL)淬灭,在二氯甲烷(20mL)中萃取并用水(5mL)和盐水溶液(5mL)洗涤。二氯甲烷层用无水硫酸钠干燥并减压浓缩。粗品通过快速色谱法纯化,洗脱液为35%的乙酸乙酯的己烷溶液,得到(2-氟苯基)(甲基)((2-(三氟甲基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜(0.14g,0.28mmol,产率58%)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ 8.64(dd,1H),8.16(q,1H),7.76-7.84(m,2H),7.50-7.55(m,2H),7.40(td,1H),3.83(s,3H)LCMS。

[0488] 表12:通过与化合物171类似的过程制备以下化合物

化合物编号	IUPAC 名称	分析数据
[0489] 172	甲基(苯基)((2-(三氟甲基)-7-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-3-基)亚氨基)- λ^6 -亚砜	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-D ₆) δ 8.74-8.65 (m, 1H), 8.24-8.13 (m,1H), 8.10-7.99 (m, 2H), 7.80-7.60 (m, 3H), 7.57-7.41 (m, 1H), 3.70-3.57 (m, 3H)) LCMS (M+1): 476

[0490] 生物学实施例:

[0491] 如本文所述,通式(I)化合物显示出杀真菌活性,该活性对攻击重要农作物的多种植物病原真菌发挥作用。本发明化合物的活性如以下试验中所述进行评价:

[0492] 真菌病原体的生物学试验例

[0493] 实施例1:稻梨孢(Pyricularia oryzae)(稻瘟病):

[0494] 将化合物溶解在0.3%的二甲亚砜中,然后在将其分配到培养皿中之前将其添加到马铃薯葡萄糖琼脂培养基中。将含有所需浓度化合物的5mL培养基分配到60mm无菌培养皿中。固化后,每块平板上接种5mm大小的菌丝盘,该菌丝盘取自活跃生长的有毒培养皿的外围。将平板在25°C温度和60%相对湿度的生长室中培养7天,然后测量径向生长并与未处理的对照进行比较。与显示广泛疾病发展的未处理检查相比,在300ppm下化合物12 33 80 87 92 103 113 114 136 138 140 142 146 161在这些试验中提供了至少70%的控制。

[0495] 实施例2:灰葡萄孢(Botrytis cinerea)(灰霉病):

[0496] 将化合物溶解在0.3%的二甲亚砜中,然后在将其分配到培养皿中之前将其添加到马铃薯葡萄糖琼脂培养基中。将含有所需浓度化合物的5mL培养基分配到60mm无菌培养皿中。固化后,每块平板上接种5mm大小的菌丝盘,该菌丝盘取自活跃生长的有毒培养皿的外围。将平板在22°C温度和90%相对湿度的生长室中培养7天,然后测量径向生长并与未处理的对照进行比较。与显示广泛疾病发展的未处理检查相比,在300ppm下化合物80在这些试验中提供了至少70%的控制。

[0497] 实施例3:茄链格孢(Alternaria solani)(番茄/马铃薯早疫病):

[0498] 将化合物溶解在0.3%二甲亚砷中,然后在将其分配到培养皿中之前将其添加到马铃薯葡萄糖琼脂培养基中。将含有所需浓度化合物的5mL培养基分配到60mm无菌培养皿中。固化后,每块平板上接种5mm大小的菌丝盘,该菌丝盘取自活跃生长的有毒培养平板的外围。将平板在25℃温度和60%相对湿度的生长室中培养7天,然后测量径向生长并与未处理的对照进行比较。与显示广泛疾病发展的未处理检查相比,在300ppm下化合物2 85 89 92 94 108 113 114 131 138 142 143 146 148 149在这些试验中提供了至少70%的控制。

[0499] 实施例4:辣椒刺盘孢(*Colletotrichum capsici*) (炭疽病):

[0500] 将化合物溶解在0.3%二甲亚砷中,然后在将其分配到培养皿中之前将其添加到马铃薯葡萄糖琼脂培养基中。将含有所需浓度化合物的5mL培养基分配到60mm无菌培养皿中。固化后,每块平板上接种5mm大小的菌丝盘,该菌丝盘取自活跃生长的有毒培养平板的外围。将平板在25℃温度和60%相对湿度的生长室中培养7天,然后测量径向生长并与未处理的对照进行比较。与显示广泛疾病发展的未处理对照相比,在300ppm下化合物46 50 65 69 111 112 116 117在这些试验中提供了至少70%的控制。

[0501] 实施例5:多主棒孢(*Corynespora cassiicola*) (番茄/大豆叶斑病):

[0502] 将化合物溶解在0.3%的二甲亚砷中,然后在将其分配到培养皿中之前将其添加到马铃薯葡萄糖琼脂培养基中。将含有所需浓度化合物的5mL培养基分配到60mm无菌培养皿中。固化后,每块平板上接种5mm大小的菌丝盘,该菌丝盘取自活跃生长的有毒培养平板的外围。将平板在25℃温度和70%相对湿度的生长室中培养7天,然后测量径向生长并与未处理的对照进行比较。与显示了广泛的疾病发展的未处理的检查相比,在300ppm下化合物18 50 100 111 117在这些试验中提供了至少70%的控制。

[0503] 实施例7:大刀镰孢(*Fusarium culmorum*) (禾谷类根腐病):

[0504] 将化合物溶解在0.3%的二甲亚砷中,然后在将其分配到培养皿中之前将其添加到马铃薯葡萄糖琼脂培养基中。将含有所需浓度化合物的5mL培养基分配到60mm无菌培养皿中。固化后,每块平板上接种5mm大小的菌丝盘,该菌丝盘取自活跃生长的有毒培养平板的外围。将平板在25℃温度和60%相对湿度的生长室中培养7天,然后测量径向生长并与未处理的对照进行比较。与显示广泛疾病发展的未处理检查相比,在300ppm下化合物50 116 117在这些试验中提供了至少70%的控制。

[0505] 实施例8:对大豆进行的豆薯层锈菌(*Phakopsora pachyrhizi*) 试验

[0506] 将化合物溶解在2%二甲亚砷/丙酮中,然后与含有乳化剂的水混合至校准喷雾体积为50mL。将此50mL喷雾溶液倒入喷雾瓶中以备进一步使用。

[0507] 为了测试化合物的预防活性,使用空心锥形喷嘴在喷雾柜内以规定的施用率用活性化合物制剂喷洒在温室中培育的健康幼小的大豆植株。处理后一天,用含有 2×10^5 豆薯层锈菌分生孢子(*Phakopsora pachyrhizi* conidia)的孢子悬浮液接种植物。然后将接种植物保存在温度为22-24℃且相对湿度为80-90%的温室中以用于疾病表达。

[0508] 通过在施用后3、7、10和15天对处理过的植物的疾病严重程度(0-100%范围)进行评级,对化合物的性能进行目视评估。通过比较处理中的疾病等级与未处理的对照之一来计算化合物的功效(%控制)。还通过记录坏死、萎黄和发育迟缓等症状来评估喷洒植物的植物相容性。与显示广泛疾病发展的未处理检查相比,在500ppm下化合物1 2

[0509] 3 4 5 6 7 8 9 10 11 13 14 15 16 17 18 19 20 21 22 23 24

[0510] 25 26 27 28 29 30 31 32 33 34 35 36 38 40 41 42 43 44 45 46 47

[0511] 48 57 58 59 63 64 65 66 67 68 69 70 71 72 73 75 76 77 78 79 82

[0512] 83 85 87 88 89 90 93 94 99 100 101 103 104 105 106 107 109 110 111
112 116

[0513] 120 121 122 126 127 129 130 150 164 165 166在这些试验中提供了至少70%的控制。

[0514] 已经参考某些优选方面描述了本发明,通过考虑说明书,其他方面对本领域技术人员将变得显而易见。对于本领域技术人员来说显而易见的是,可以在不脱离本发明范围的情况下对材料和方法进行许多修改。