



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 104995177 A

(43) 申请公布日 2015. 10. 21

(21) 申请号 201380072893. 4 (51) Int. Cl.  
 (22) 申请日 2013. 12. 06 C07D 237/08(2006. 01)  
 (30) 优先权数据 C07D 239/26(2006. 01)  
 61/737, 114 2012. 12. 14 US C07D 241/12(2006. 01)  
 (85) PCT国际申请进入国家阶段日 C07D 213/57(2006. 01)  
 2015. 08. 13 A01P 17/00(2006. 01)  
 (86) PCT国际申请的申请数据 A01N 37/34(2006. 01)  
 PCT/EP2013/075794 2013. 12. 06 A61K 31/44(2006. 01)  
 (87) PCT国际申请的公布数据  
 W02014/090700 EN 2014. 06. 19  
 (71) 申请人 巴斯夫欧洲公司  
 地址 德国路德维希港  
 (72) 发明人 R·保利尼 M·波尔曼 S·索格尔  
 H·M·M·巴斯蒂安斯 S·汤普森  
 C·埃布恩加 德扬  
 A·玛尔维达 乌玛利  
 R·苏扎 科萨雷  
 (74) 专利代理机构 北京市中咨律师事务所  
 11247  
 代理人 王丹丹 刘金辉

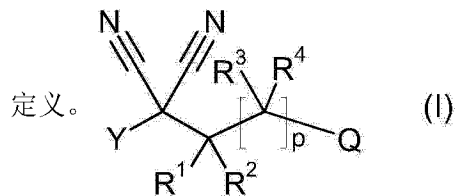
权利要求书11页 说明书120页

(54) 发明名称

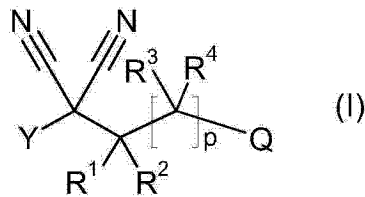
用于防治动物害虫的丙二腈化合物

(57) 摘要

本发明涉及式 (I) 化合物或其盐在防治动物害虫中的用途, 其中各符号和指数如说明书中所



1. 式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物 :



其中

Y 为未被取代或被 1、2、3、4 或 5 个取代基  $R^5$  取代的苯基 ; 或为未被取代或被 1、2、3、4、5、6 或 7 个取代基  $R^5$  取代的萘基 ;

Q 为在环中含有 1、2、3 或 4 个氮原子的 6 员芳族杂环, 其中上述环未被取代或被 1、2、3 或 4 个取代基  $R^6$  取代 ;

$R^1$  为氢、卤素、氰基、羟基、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  链烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_3-C_8$  环烯基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_2-C_6$  链烯氧基、 $C_1-C_6$  烷硫基、 $C_1-C_6$  烷氧羰基, 其中上述脂族或脂环族基团的碳原子未被取代或被 1、2 或 3 个取代基  $R^7$  取代 ;

$R^2$  为氢或卤素 ; 或者

$R^1$  和  $R^2$  与它们所连接的碳原子一起形成亚甲基或环丙基 ;

$R^3$  为氢、卤素、氰基、羟基、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  链烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_3-C_8$  环烯基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_2-C_6$  链烯氧基、 $C_1-C_6$  烷硫基、 $C_1-C_6$  烷氧羰基, 其中上述脂族或脂环族基团的碳原子未被取代或被 1、2 或 3 个取代基  $R^7$  取代 ;

$R^4$  为氢或卤素 ; 或者

$R^3$  和  $R^4$  与它们所连接的碳原子一起形成亚甲基或环丙基 ;

$R^5$ 、 $R^6$  各自独立地为卤素、氰基、叠氮基、硝基、 $-SCN$ 、 $SF_5$ 、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  链烯基、 $C_2-C_6$  炔基, 其中上述脂族基团的碳原子未被取代或被一个或多个  $R^a$  取代 ;

$C_3-C_8$  环烷基或  $C_3-C_8$  环烯基, 其中上述脂环族基团的碳原子未被取代或被一个或多个  $R^b$  取代 ;

未被取代或被至多 5 个  $R^c$  取代的苯基 ;

含有 1、2 或 3 个选自 N、O、S、NO、SO、 $SO_2$  的杂原子或杂原子基团的 3、4、5、6 或 7 员饱和、部分不饱和或芳族杂环, 其中上述环未被取代或被至多 5 个  $R^d$  取代 ;

$Si(R^e)_3$ 、 $OR^f$ 、 $SR^f$ 、 $OS(O)_xR^h$ 、 $S(O)_xR^h$ 、 $N(R^i)_2$ 、 $N(R^i)C(=O)R^m$ 、 $OC(=O)R^m$ 、 $C(=O)R^m$ 、 $C(=O)OR^f$ 、 $C(=NR^i)R^m$ 、 $C(=S)R^m$ ; 或者

在两个存在于一个苯基环上的相邻碳原子上的两个  $R^5$  一起为选自  $CH_2CH_2CH_2CH_2$ 、 $N=CH-CH=CH$ 、 $CH=N-CH=CH$ 、 $N=CH-N=CH$ 、 $N=CH-CH=N$ 、 $OCH_2CH_2CH_2$ 、 $OCH=CHCH_2$ 、 $CH_2OCH_2CH_2$ 、 $OCH_2CH_2O$ 、 $OCH_2OCH_2$ 、 $CH_2CH_2CH_2$ 、 $CH=CHCH_2$ 、 $CH_2CH_2O$ 、 $CH=CHO$ 、 $CH_2OCH_2$ 、 $CH_2C(=O)O$ 、 $C(=O)OCH_2$ 、 $O(CH_2)O$ 、 $SCH_2CH_2CH_2$ 、 $SCH=CHCH_2$ 、 $CH_2SCH_2CH_2$ 、 $SCH_2CH_2S$ 、 $SCH_2SCH_2$ 、 $CH_2CH_2S$ 、 $CH=CHS$ 、 $CH_2SCH_2$ 、 $CH_2C(=S)S$ 、 $C(=S)SCH_2$ 、 $S(CH_2)S$ 、 $CH_2CH_2NR^k$ 、 $CH_2CH=N$ 、 $CH=CH-NR^k$ 、 $OCH=N$ 、 $SCH=N$  的桥并且与这两个  $R^5$  键合的碳原子一起形成 5 或 6 员部分不饱和或芳族碳环或杂环, 其中所述环未被取代或被 1 或 2 个选自  $=O$ 、 $OH$ 、 $CH_3$ 、 $OCH_3$ 、卤素、卤代甲基和卤代甲氧基的取代基取代 ;

$R^7$  各自独立地为卤素、氰基、羟基、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  链烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、

C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基、OSi(R<sup>e</sup>)<sub>3</sub>, 其中上述脂族或脂环族基团的碳原子未被取代、部分或完全被卤代和 / 或被氧化;

R<sup>a</sup>各自独立地为卤素、氰基、叠氮基、硝基、-SCN、SF<sub>5</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷硫基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>卤代环烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基 -C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基,

Si(R<sup>e</sup>)<sub>3</sub>、OR<sup>A</sup>、SR<sup>A</sup>、OSO<sub>2</sub>R<sup>B</sup>、S(O)<sub>x</sub>R<sup>B</sup>、-S(O)<sub>x</sub>N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=S)N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)OR<sup>A</sup>,

未被取代或被至多 5 个 R<sup>F</sup>取代的苯基;

含有 1、2 或 3 个选自 N、O、S、NO、SO、SO<sub>2</sub>的杂原子或杂原子基团的 3、4、5、6 或 7 员饱和、部分不饱和或芳族杂环, 其中上述环未被取代或被至多 5 个 R<sup>F</sup>取代, 或者

存在于一个碳原子上的两个 R<sup>a</sup>一起为 = O、= C(R<sup>F</sup>)<sub>2</sub>、= NR<sup>D</sup>、= NOR<sup>A</sup>、= NNR<sup>D</sup>, 或者

两个 R<sup>a</sup>与这两个 R<sup>a</sup>所键合的碳原子一起形成 3、4、5、6、7 或 8 员饱和或部分不饱和碳环或杂环;

R<sup>b</sup>各自独立地为卤素、氰基、叠氮基、硝基、-SCN、SF<sub>5</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷硫基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>卤代环烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基 -C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基,

Si(R<sup>c</sup>)<sub>3</sub>、OR<sup>H</sup>、SR<sup>H</sup>、OSO<sub>2</sub>R<sup>J</sup>、S(O)<sub>x</sub>R<sup>J</sup>、-S(O)<sub>x</sub>N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、C(=S)N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)OR<sup>H</sup>, 或者

存在于一个碳原子上的两个 R<sup>b</sup>一起为 = O、= C(R<sup>L</sup>)<sub>2</sub>、= NR<sup>K</sup>、= NOR<sup>H</sup>、= NNR<sup>K</sup>, 或者

两个 R<sup>b</sup>与这两个 R<sup>b</sup>所键合的碳原子一起形成 3、4、5、6、7 或 8 员饱和或部分不饱和碳环或杂环;

R<sup>c</sup>各自独立地为卤素、氰基、叠氮基、硝基、-SCN、SF<sub>5</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基, 其中上述脂族或脂环族基团的碳原子未被取代或被一个或多个 R<sup>M</sup>取代;

Si(R<sup>c</sup>)<sub>3</sub>、OR<sup>H</sup>、SR<sup>H</sup>、OS(O)<sub>x</sub>R<sup>J</sup>、S(O)<sub>x</sub>R<sup>J</sup>、-S(O)<sub>x</sub>N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>N</sup>、C(=O)OR<sup>H</sup>、C(=NR<sup>K</sup>)R<sup>N</sup>、C(=O)N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、C(=S)N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>;

R<sup>d</sup>各自独立地为卤素、氰基、叠氮基、硝基、-SCN、SF<sub>5</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基, 其中上述脂族或脂环族基团的碳原子未被取代或被一个或多个 R<sup>M</sup>取代;

Si(R<sup>c</sup>)<sub>3</sub>、OR<sup>H</sup>、SR<sup>H</sup>、OS(O)<sub>x</sub>R<sup>J</sup>、S(O)<sub>x</sub>R<sup>J</sup>、-S(O)<sub>x</sub>N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>N</sup>、C(=O)OR<sup>H</sup>、C(=NR<sup>K</sup>)R<sup>N</sup>、C(=O)N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、C(=S)N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>, 或者

两个存在于饱和或部分不饱和杂环的一个原子上的 R<sup>d</sup>一起为 = O、= C(R<sup>L</sup>)<sub>2</sub>、= NR<sup>K</sup>、= NOR<sup>H</sup>或 = NNR<sup>K</sup>;

R<sup>e</sup>各自独立地为卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>卤代环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基烷基,

苯基、含有 1、2 或 3 个选自 N、O、S、NO、SO、SO<sub>2</sub>的杂原子或杂原子基团的 3、4、5、6 或 7 员饱和、部分不饱和或芳族杂环;

R<sup>f</sup>各自独立地为氢、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环

烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基,其中上述脂族或脂环族基团的碳原子未被取代或被一个或多个 R<sup>M</sup>取代;

Si(R<sup>E</sup>)<sub>3</sub>、S(O)<sub>x</sub>R<sup>B</sup>、-S(O)<sub>x</sub>N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、-N=C(R<sup>F</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>Q</sup>、C(=O)N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=S)N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)OR<sup>A</sup>,

苯基、含有 1、2 或 3 个选自 N、O、S、NO、SO、SO<sub>2</sub> 的杂原子或杂原子基团的 3、4、5、6 或 7 员饱和、部分不饱和或芳族杂环;

R<sup>h</sup>各自独立地为氢、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基,其中上述脂族或脂环族基团的碳原子未被取代或被一个或多个 R<sup>M</sup>取代;

N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、-N=C(R<sup>F</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>Q</sup>、C(=O)N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=S)N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)OR<sup>A</sup>, 苯基、含有 1、2 或 3 个选自 N、O、S、NO、SO、SO<sub>2</sub> 的杂原子或杂原子基团的 3、4、5、6 或 7 员饱和、部分不饱和或芳族杂环;

R<sup>i</sup>各自独立地为氢、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基,其中上述脂族或脂环族基团的碳原子未被取代或被一个或多个 R<sup>M</sup>取代;

S(O)<sub>x</sub>R<sup>B</sup>、-S(O)<sub>x</sub>N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>S</sup>、C(=O)OR<sup>A</sup>、C(=O)N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=S)R<sup>S</sup>、C(=S)SR<sup>A</sup>、C(=S)N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=NR<sup>D</sup>)R<sup>S</sup>,

未被取代或被至多 5 个 R<sup>F</sup>取代的苯基;

含有 1、2 或 3 个选自 N、O、S、NO、SO、SO<sub>2</sub> 的杂原子或杂原子基团的 3、4、5、6 或 7 员饱和、部分不饱和或芳族杂环,其中上述环未被取代或被至多 5 个 R<sup>F</sup>取代,或者

两个在一个氮原子上的 R<sup>i</sup>一起为 C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>亚烷基链且与它们所键合的氮原子一起形成 3、4、5、6、7 或 8 员饱和、部分不饱和或芳族环,其中亚烷基链可以含有 1 或 2 个选自 N、O、S、NO、SO、SO<sub>2</sub> 的杂原子或杂原子基团并且其中亚烷基链未被取代或被卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代炔基取代;

R<sup>m</sup>各自独立地为氢、-SCN、SF<sub>5</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基,其中上述脂族或脂环族基团的碳原子未被取代或被一个或多个 R<sup>M</sup>取代;

Si(R<sup>E</sup>)<sub>3</sub>、OR<sup>A</sup>、SR<sup>A</sup>、OSO<sub>2</sub>R<sup>B</sup>、N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=S)N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)OR<sup>A</sup>,

未被取代或被至多 5 个 R<sup>F</sup>取代的苯基;

含有 1、2 或 3 个选自 N、O、S、NO、SO、SO<sub>2</sub> 的杂原子或杂原子基团的 3、4、5、6 或 7 员饱和、部分不饱和或芳族杂环,其中上述环未被取代或被至多 5 个 R<sup>F</sup>取代;

R<sup>A</sup>各自独立地为氢、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基,

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基,其中后提到的 4 个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或被氧化和 / 或带有 1 或 2 个选自 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基的基团;

苯基、苄基、吡啶基、苯氧基,其中后提到的 4 个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或带有 1、2 或 3 个选自 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基和 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基的取代基;

R<sup>B</sup>各自独立地为氢、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷硫基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲



基甲硅烷基,

$C_1-C_6$ 烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_3-C_8$ 环烷基,其中后提到的4个基团未被取代、部分或完全被卤代和/或被氧化和/或带有1或2个选自 $C_1-C_4$ 烷氧基的基团;

苯基、苄基、吡啶基、苯氧基,其中后提到的4个基团未被取代、部分或完全被卤代和/或带有1、2或3个选自 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基和 $C_1-C_6$ 烷氧羰基的取代基;

$R^D$ 各自独立地为氢、氰基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1-C_6$ 烷硫基、 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ 卤代烷硫基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基,

$C_1-C_6$ 烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_3-C_8$ 环烷基,其中后提到的4个基团未被取代、部分或完全被卤代和/或被氧化和/或带有1或2个选自 $C_1-C_4$ 烷氧基的基团;

苯基、苄基、吡啶基、苯氧基,其中后提到的4个基团未被取代、部分或完全被卤代和/或带有1、2或3个选自 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基和 $C_1-C_6$ 烷氧羰基的取代基,或者

两个在一个氮原子上的 $R^D$ 一起为 $C_2-C_6$ 亚烷基链且与它们所键合的氮原子一起形成3、4、5、6或7员饱和、部分不饱和或芳族环,其中亚烷基链可以含有1或2个选自N、O、S、NO、SO、SO<sub>2</sub>的杂原子或杂原子基团并且其中亚烷基链未被取代或被卤素、 $C_1-C_4$ 卤代烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基或 $C_1-C_4$ 卤代烷氧基取代;

$R^E$ 各自独立地为氰基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1-C_6$ 烷硫基、 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ 卤代烷硫基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基,

$C_1-C_6$ 烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_2-C_6$ 炔基,其中后提到的4个基团未被取代、部分或完全被卤代和/或被氧化和/或带有1或2个选自 $C_1-C_4$ 烷氧基的基团,或者

两个存在于饱和或部分不饱和杂环的一个原子上的 $R^E$ 一起为 $=O$ 、 $=N(C_1-C_6$ 烷基)、 $=NO(C_1-C_6$ 烷基)、 $=CH(C_1-C_4$ 烷基)或 $=C(C_1-C_4$ 烷基) $C_1-C_4$ 烷基;

$R^F$ 各自独立地为 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_6$ 环烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基烷基、苯基或苄基;

$R^G$ 各自独立地为卤素、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_2-C_6$ 卤代链烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_2-C_6$ 卤代炔基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基烷基;

$R^H$ 各自独立地为氢、氰基、 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基,

$C_1-C_6$ 烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_2-C_6$ 炔基,其中后提到的3个基团未被取代、部分或完全被卤代和/或被氧化和/或带有1或2个选自 $C_1-C_4$ 烷氧基的基团;

$R^J$ 各自独立地为氢、氰基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1-C_6$ 烷硫基、 $C_1-C_6$ 卤代烷硫基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基,

$C_1-C_6$ 烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_2-C_6$ 炔基,其中后提到的3个基团未被取代、部分或完全被卤代和/或被氧化和/或带有1或2个选自 $C_1-C_4$ 烷氧基的基团;

$R^K$ 各自独立地为氢、氰基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1-C_6$ 烷硫基、 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ 卤代烷硫基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基,

$C_1-C_6$ 烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_2-C_6$ 炔基，其中后提到的3个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或被氧化和 / 或带有1或2个选自 $C_1-C_4$ 烷氧基的基团；

$R^l$ 各自独立地为 $C_1-C_4$ 烷基或 $C_1-C_4$ 烷氧基烷基；

$R^m$ 各自独立地为卤素、氰基、叠氮基、硝基、OH、SH、-SCN、 $SF_5$ 、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1-C_6$ 烷硫基、 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ 卤代烷硫基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基，

$C_1-C_6$ 烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_3-C_8$ 环烷基、 $C_1-C_6$ 烷基- $C_3-C_8$ 环烷基，其中后提到的5个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或被氧化和 / 或带有1或2个选自 $C_1-C_4$ 烷氧基的基团，或者

存在于一个碳原子上的两个 $R^m$ 一起为 $=O$ 、 $=CH(C_1-C_4$ 烷基)、 $=C(C_1-C_4$ 烷基) $C_1-C_4$ 烷基、 $=N(C_1-C_6$ 烷基)或 $=NO(C_1-C_6$ 烷基)；

$R^n$ 各自独立地为氢、OH、SH、-SCN、 $SF_5$ 、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1-C_6$ 烷硫基、 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ 卤代烷硫基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_2-C_6$ 炔基，其中后提到的3个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或被氧化和 / 或带有1或2个选自 $C_1-C_4$ 烷氧基的基团；

$R^o$ 各自独立地为氢、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1-C_6$ 烷硫基、 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ 卤代烷硫基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基，

$C_1-C_6$ 烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_3-C_8$ 环烷基，其中后提到的4个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或被氧化和 / 或带有1或2个选自 $C_1-C_4$ 烷氧基的基团；

苯基、苄基、吡啶基、苯氧基，其中后提到的4个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或带有1、2或3个选自 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基和 $C_1-C_6$ 烷氧羰基的取代基；

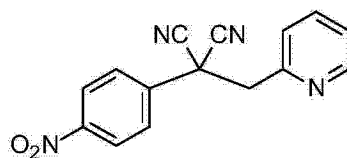
$R^s$ 各自独立地为氢、OH、SH、-SCN、 $SF_5$ 、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1-C_6$ 烷硫基、 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ 卤代烷硫基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_3-C_8$ 环烷基，其中后提到的4个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或被氧化和 / 或带有1或2个选自 $C_1-C_4$ 烷氧基的基团；

苯基、苄基、吡啶基、苯氧基，其中后提到的4个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或带有1、2或3个选自 $C_1-C_6$ 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、 $C_1-C_6$ 烷氧羰基、 $C_1-C_6$ 烷基氨基和二- $C_1-C_6$ 烷基氨基的取代基；

p 为 0 或 1；

x 为 1 或 2，

条件是排除下列化合物：



2. 根据权利要求 1 的化合物，其中

$R^5$ 、 $R^6$ 各自独立地为卤素、氰基、叠氮基、硝基、 $-\text{SCN}$ 、 $\text{SF}_5$ 、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ 链烯基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ 炔基,其中上述脂族基团的碳原子未被取代或被一个或多个  $R^a$ 取代;

$\text{C}_3$ - $\text{C}_8$ 环烷基或  $\text{C}_3$ - $\text{C}_8$ 环烯基,其中上述脂环族基团的碳原子未被取代或被一个或多个  $R^b$ 取代;

未被取代或被至多 5 个  $R^c$ 取代的苯基;

含有 1、2 或 3 个选自 N、O、S、NO、SO、 $\text{SO}_2$ 的杂原子或杂原子基团的 3、4、5、6 或 7 员饱和、部分不饱和或芳族杂环,其中上述环未被取代或被至多 5 个  $R^d$ 取代;

$\text{Si}(\text{R}^e)_3$ 、 $\text{OR}^f$ 、 $\text{SR}^f$ 、 $\text{OS}(\text{O})_x\text{R}^h$ 、 $\text{S}(\text{O})_x\text{R}^h$ 、 $\text{N}(\text{R}^i)_2$ 、 $\text{N}(\text{R}^i)\text{C}(=\text{O})\text{R}^m$ 、 $\text{OC}(=\text{O})\text{R}^m$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{R}^m$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{OR}^f$ 、 $\text{C}(=\text{NR}^i)\text{R}^m$ 、 $\text{C}(=\text{S})\text{R}^m$ ;或者

在两个存在于一个苯基环上的相邻碳原子上的两个  $R^5$ 一起为选自  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{N}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}$ 、 $\text{CH}=\text{N}-\text{CH}=\text{CH}$ 、 $\text{N}=\text{CH}-\text{N}=\text{CH}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{OCH}=\text{CHCH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 、 $\text{OCH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}=\text{CHCH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 、 $\text{CH}=\text{CHO}$ 、 $\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{O}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{OCH}_2$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)\text{O}$ 、 $\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{SCH}=\text{CHCH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{S}$ 、 $\text{SCH}_2\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}$ 、 $\text{CH}=\text{CHS}$ 、 $\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{S}$ 、 $\text{C}(=\text{S})\text{SCH}_2$ 、 $\text{S}(\text{CH}_2)\text{S}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NR}^k$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{N}$ 、 $\text{CH}=\text{CH}-\text{NR}^k$ 、 $\text{OCH}=\text{N}$ 、 $\text{SCH}=\text{N}$ 的桥并且与这两个  $R^5$ 键合的碳原子一起形成 5 或 6 员部分不饱和或芳族碳环或杂环,其中所述环未被取代或被 1 或 2 个选自  $=\text{O}$ 、 $\text{OH}$ 、 $\text{CH}_3$ 、 $\text{OCH}_3$ 、卤素、卤代甲基和卤代甲氧基的取代基取代。

3. 根据权利要求 1 的化合物,其中

Y 为未被取代或被 1、2、3、4 或 5 个取代基  $R^5$ 取代的苯基;或未被取代或被 1 或 2 个取代基  $R^5$ 取代的萘基;

Q 为在环中含有 1、2 或 3 个氮原子的 6 员芳族杂环,其中上述环未被取代或被 1、2、3 或 4 个取代基  $R^6$ 取代;

$R^1$ 为 H、卤素、氰基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ 链烯基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ 炔基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 环烷基或  $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷氧羰基,其中后提到的 5 个基团未被取代或被 1、2 或 3 个选自卤素、氰基、羟基、 $\text{OSi}(\text{C}_1\text{-}\text{C}_6\text{烷基})_3$ 、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ 链烯基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ 炔基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 环烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷氧基和  $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷氧羰基的取代基取代,其中后提到的 6 个基团未被取代或部分或完全被卤代;

$R^2$ 为 H 或卤素;或者

$R^1$ 和  $R^2$ 与它们所连接的碳原子一起形成亚甲基;

$R^3$ 为 H、卤素、氰基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ 链烯基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ 炔基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 环烷基或  $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷氧羰基,其中后提到的 5 个基团未被取代或被 1、2 或 3 个选自卤素、氰基、羟基、 $\text{OSi}(\text{C}_1\text{-}\text{C}_6\text{烷基})_3$ 、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ 链烯基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ 炔基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 环烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷氧基和  $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷氧羰基的取代基取代,其中后提到的 6 个基团未被取代或部分或完全被卤代;

$R^4$ 为 H 或卤素;或者

$R^3$ 和  $R^4$ 与它们所连接的碳原子一起形成亚甲基;

$R^5$ 为卤素、氰基、 $\text{SF}_5$ 、三- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 甲硅烷基- $\text{C}_2$ - $\text{C}_4$ 炔基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基氨基羰基、二- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基氨基羰基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ 链烯基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ 炔基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 环烷基、苯基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷硫基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基亚磺酰基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基磺酰基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷氧羰基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基氨基、二- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基氨基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基羰基或  $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基羰氧基,其中后提到的 14 个基团未被取代或被一个或多个选自卤素、氰基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基- $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 环烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ 链烯基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ 炔基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 环

烷基和 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基的取代基取代,其中后提到的 5 个基团未被取代或部分或完全被卤代;或者

在两个存在于一个苯基环上的相邻碳原子上的两个 R<sup>5</sup>一起为选自 N = CH-CH = CH、N = CH-CH = N、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O、O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O 的桥并且与这两个 R<sup>5</sup>键合的碳原子一起形成 5 或 6 员部分不饱和或芳族杂环,其中所述环未被取代;

R<sup>6</sup>为卤素、氰基、SF<sub>5</sub>、三 -C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>甲硅烷基 -C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基、二 -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、苯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基、二 -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰氧基,其中后提到的 14 个基团未被取代或被一个或多个选自卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基 -C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基和 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基的取代基取代,其中后提到的 5 个基团未被取代或部分或完全被卤代;

p 为 0 或 1。

4. 根据权利要求 1-3 中任一项的化合物,其中

Y 为未被取代或被 1、2、3 或 4 个取代基 R<sup>5</sup>取代的苯基;或未被取代或被 1 或 2 个取代基 R<sup>5</sup>取代的萘基;

Q 为在环中含有 1、2 或 3 个氮原子的 6 员芳族杂环,其中上述环未被取代或被 1、2、3 或 4 个取代基 R<sup>6</sup>取代;

R<sup>1</sup>为 H、卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基,其中后提到的 5 个基团未被取代或被 1、2 或 3 个选自卤素、氰基、羟基、OSi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)<sub>3</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基和 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基的取代基取代,其中后提到的 6 个基团未被取代或部分或完全被卤代;

R<sup>2</sup>为 H 或卤素;或者

R<sup>1</sup>和 R<sup>2</sup>与它们所连接的碳原子一起形成亚甲基;

R<sup>3</sup>为 H、卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基,其中后提到的 5 个基团未被取代或被 1、2 或 3 个选自卤素、氰基、羟基、OSi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)<sub>3</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基和 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基的取代基取代,其中后提到的 6 个基团未被取代或部分或完全被卤代;

R<sup>4</sup>为 H 或卤素;或者

R<sup>3</sup>和 R<sup>4</sup>与它们所连接的碳原子一起形成亚甲基;

R<sup>5</sup>为卤素、氰基、SF<sub>5</sub>、三 -C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>甲硅烷基 -C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基、二 -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、苯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基、二 -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰氧基,其中后提到的 14 个基团未被取代或被一个或多个选自卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基 -C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基和 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基的取代基取代,其中后提到的 5 个基团未被取代或部分或完全被卤代;

R<sup>6</sup>为卤素、氰基、SF<sub>5</sub>、三 -C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>甲硅烷基 -C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基、二 -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、苯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基、二 -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰氧基,其中后提到的 14 个基团未被取代或被一个或

多个选自卤素、氰基、 $C_1-C_4$ 烷基、 $-C_3-C_6$ 环烷基、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_3-C_6$ 环烷基和  $C_1-C_6$ 烷氧基的取代基取代,其中后提到的 5 个基团未被取代或部分或完全被卤代;  
p 为 0 或 1。

5. 根据权利要求 1-4 中任一项的化合物,其中  $R^1$  为 H、Me、Et、iPr、cPr、 $CH_2CN$ 、 $CF_3$ 、 $CHF_2$ 、 $CH_2F$ 、 $CH_2CH_2F$ 、 $CH_2CHF_2$ 、 $CH_2CF_3$ 、CN、卤素、 $CH_2OH$ 、 $CH_2OMe$ 、 $CH_2OEt$ 、 $CO_2Me$ 、 $CO_2Et$ 、 $CH_2CO_2Me$ 、 $CH_2CO_2Et$ 、 $CH_2OSi(Me)_3$  或  $CH_2OSi(Et)_3$ 。

6. 根据权利要求 1-5 中任一项的化合物,其中  $R^3$  为 H、Me、Et、iPr、cPr、 $CH_2CN$ 、 $CF_3$ 、 $CHF_2$ 、 $CH_2F$ 、 $CH_2CH_2F$ 、 $CH_2CHF_2$ 、 $CH_2CF_3$ 、CN、卤素、 $CH_2OH$ 、 $CH_2OMe$ 、 $CH_2OEt$ 、 $CO_2Me$ 、 $CO_2Et$ 、 $CH_2CO_2Me$ 、 $CH_2CO_2Et$ 、 $CH_2OSi(Me)_3$  或  $CH_2OSi(Et)_3$ 。

7. 根据权利要求 1、3、5 或 6 中任一项的化合物,其中  $R^5$  为卤素、Me、Et、iPr、cPr、OMe、OEt、OiPr、乙炔基、(三甲基甲硅烷基)乙炔基、乙烯基、Ph、CN、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $SF_5$ 、 $CHF_2$ 、 $OCHF_2$ 、SMe、S(O)Me、S(O)<sub>2</sub>Me、 $SCF_3$ 、S(O) $CF_3$ 、S(O)<sub>2</sub> $CF_3$ 、 $SCHF_2$ 、S(O) $CHF_2$ 、S(O)<sub>2</sub> $CHF_2$ 、 $CO_2Me$ 、 $CO_2Et$ 、C(O)Me、OAc、C(O)NHMe、C(O)NMe<sub>2</sub>、 $CH_2OMe$  或  $CH_2OEt$ ; 或者在两个存在于一个苯基环上的相邻碳原子上的两个  $R^5$  一起为选自  $N = CH-CH = CH$ 、 $N = CH-CH = N$ 、 $OCH_2CH_2O$ 、 $O(CH_2)_2O$  的桥并且与这两个  $R^5$  键合的碳原子一起形成 5 或 6 员部分不饱和或芳族杂环,其中所述环未被取代。

8. 根据权利要求 1-7 中任一项的化合物,其中  $R^5$  为卤素、Me、Et、iPr、cPr、OMe、OEt、OiPr、乙炔基、(三甲基甲硅烷基)乙炔基、乙烯基、Ph、CN、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $SF_5$ 、 $CHF_2$ 、 $OCHF_2$ 、SMe、S(O)Me、S(O)<sub>2</sub>Me、 $SCF_3$ 、S(O) $CF_3$ 、S(O)<sub>2</sub> $CF_3$ 、 $SCHF_2$ 、S(O) $CHF_2$ 、S(O)<sub>2</sub> $CHF_2$ 、 $CO_2Me$ 、 $CO_2Et$ 、C(O)Me、OAc、C(O)NHMe、C(O)NMe<sub>2</sub>、 $CH_2OMe$  或  $CH_2OEt$ 。

9. 根据权利要求 1-8 中任一项的化合物,其中  $R^6$  为卤素、Me、Et、iPr、cPr、OMe、OEt、OiPr、乙炔基、(三甲基甲硅烷基)乙炔基、乙烯基、Ph、CN、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $SF_5$ 、 $CHF_2$ 、 $OCHF_2$ 、SMe、S(O)Me、S(O)<sub>2</sub>Me、 $SCF_3$ 、S(O) $CF_3$ 、S(O)<sub>2</sub> $CF_3$ 、 $SCHF_2$ 、S(O) $CHF_2$ 、S(O)<sub>2</sub> $CHF_2$ 、 $CO_2Me$ 、 $CO_2Et$ 、C(O)Me、OAc、C(O)NHMe、C(O)NMe<sub>2</sub>、 $CH_2OMe$  或  $CH_2OEt$ 。

10. 根据权利要求 1 的化合物,其中

Y 为未被取代或被 1、2、3、4 或 5 个取代基  $R^5$  取代的苯基;或未被取代或被 1 个取代基  $R^5$  取代的萘基;

Q 为在环中含有 1、2 或 3 个氮原子的 6 员芳族杂环,其中上述环未被取代或被 1、2 或 3 个取代基  $R^6$  取代;

$R^1$  为 H、Me、Et、CN、 $CH_2CN$ 、 $CH_2CF_3$ 、卤素、 $CH_2OH$ 、 $CH_2OMe$ 、 $CH_2OEt$ 、 $CH_2CO_2Me$ 、 $CH_2CO_2Et$ 、 $CH_2OSi(Me)_3$  或  $CH_2OSi(Et)_3$ ;

$R^2$  为 H 或卤素;

$R^3$  为 H、Me、Et、CN、 $CH_2CN$ 、 $CH_2CF_3$ 、卤素、 $CH_2OH$ 、 $CH_2OMe$ 、

$CH_2OEt$ 、 $CH_2CO_2Me$ 、 $CH_2CO_2Et$ 、 $CH_2OSi(Me)_3$  或  $CH_2OSi(Et)_3$ ;

$R^4$  为 H 或卤素;

$R^5$  为卤素、氰基、三- $C_1-C_4$ 甲硅烷基、 $-C_2-C_4$ 炔基、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_3-C_6$ 环烷基、苯基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 烷硫基或  $C_1-C_6$ 烷氧羰基,其中后提到的 8 个基团未被取代或部分或完全被卤代;或者

在两个存在于一个苯基环上的相邻碳原子上的两个  $R^5$  一起为选自  $N = CH-CH = CH$ 、 $N$

= CH-CH = N、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O、O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O 的桥并且与这两个 R<sup>5</sup>键合的碳原子一起形成 5 或 6 员部分不饱和或芳族杂环,其中所述环未被取代;

R<sup>6</sup>为卤素、氰基、三 -C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>甲硅烷基 -C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、苯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基,其中后提到的 8 个基团未被取代或部分或完全被卤代;p 为 0 或 1。

11. 根据权利要求 1、2 或 10 中任一项的化合物,其中

Y 为未被取代或被 1、2 或 3 个取代基 R<sup>5</sup>取代的苯基;或未被取代或被 1 个取代基 R<sup>5</sup>取代的萘基;

Q 为在环中含有 1、2 或 3 个氮原子的 6 员芳族杂环,其中上述环未被取代或被 1、2 或 3 个取代基 R<sup>6</sup>取代;

R<sup>1</sup>为 H、Me、Et、CN、CH<sub>2</sub>CN、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、卤素、CH<sub>2</sub>OH、CH<sub>2</sub>OMe、CH<sub>2</sub>OEt、CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、CH<sub>2</sub>OSi(Me)<sub>3</sub>或 CH<sub>2</sub>OSi(Et)<sub>3</sub>;

R<sup>2</sup>为 H 或卤素;

R<sup>3</sup>为 H、Me、Et、CN、CH<sub>2</sub>CN、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、卤素、CH<sub>2</sub>OH、CH<sub>2</sub>OMe、CH<sub>2</sub>OEt、CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、CH<sub>2</sub>OSi(Me)<sub>3</sub>或 CH<sub>2</sub>OSi(Et)<sub>3</sub>;

R<sup>4</sup>为 H 或卤素;

R<sup>5</sup>为卤素、氰基、三 -C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>甲硅烷基 -C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、苯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基,其中后提到的 8 个基团未被取代或部分或完全被卤代;

R<sup>6</sup>为卤素、氰基、三 -C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>甲硅烷基 -C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、苯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基,其中后提到的 8 个基团未被取代或部分或完全被卤代;p 为 0 或 1。

12. 根据权利要求 1-11 中任一项的化合物,其中 R<sup>5</sup>为卤素、Me、OMe、CN、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>或乙炔基。

13. 根据权利要求 1-12 中任一项的化合物,其中 R<sup>6</sup>为卤素、Me、OMe、CN、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>或乙炔基。

14. 根据权利要求 1、2、10 或 11 中任一项的化合物,其中

Y 为未被取代或被 1、2 或 3 个取代基 R<sup>5</sup>取代的苯基;

Q 为吡啶基、嘧啶基、吡嗪基或哒嗪基,其中上述环未被取代或被 1 或 2 个取代基 R<sup>6</sup>取代;

R<sup>1</sup>为 H、F、Me、Et、CN、CH<sub>2</sub>CN 或 CH<sub>2</sub>OMe;

R<sup>2</sup>为 H;

R<sup>3</sup>为 H、F、Me、Et、CN、CH<sub>2</sub>CN 或 CH<sub>2</sub>OMe;

R<sup>4</sup>为 H;

R<sup>5</sup>为 F、Cl、CN、乙炔基、Me、OMe 或 CF<sub>3</sub>;

R<sup>6</sup>为 F、乙炔基、Br 或 CF<sub>3</sub>;

p 为 0 或 1。

15. 根据权利要求 1-14 中任一项的化合物,其中 R<sup>1</sup>为 H。

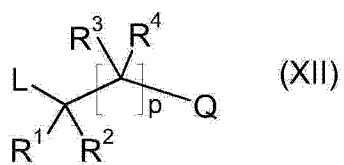
16. 根据权利要求 1-15 中任一项的化合物,其中 R<sup>3</sup>为 H。

17. 根据权利要求 1-5、7-15 中任一项的化合物,其中 p 为 0。
18. 根据权利要求 1-17 中任一项的化合物,其中 Q 为吡啶基或嘧啶基,其中上述环未被取代或被一个或多个 R<sup>6</sup>取代。
19. 根据权利要求 1-5、7-15、17 或 18 中任一项的化合物,其中 R<sup>1</sup>和 R<sup>2</sup>为 H 且 p 为 0。
20. 一种农业和 / 或兽用组合物,包含至少一种根据权利要求 1-19 中任一项的式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物。
21. 根据权利要求 20 的组合物,进一步包含至少一种惰性液体和 / 或至少一种固体载体。
22. 根据权利要求 1-19 中任一项的式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物在防治动物害虫中的用途。
23. 一种防治动物害虫的方法,包括使动物害虫、其栖息地、繁殖地、食物供应源,其中害虫生长或可能生长的植物、种子、土壤、区域、材料或环境,或者要防止动物侵袭或侵染的材料、植物、种子、土壤、表面或空间与杀虫有效量的至少一种根据权利要求 1-19 中任一项的式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物接触。
24. 一种保护作物以防动物害虫侵袭或侵染的方法,包括使作物与杀虫有效量的至少一种根据权利要求 1-19 中任一项的式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物接触。
25. 一种保护种子以防土壤昆虫以及保护秧苗的根和芽以防土壤和叶面昆虫的方法,包括在播种之前和 / 或在预萌发之后使种子与至少一种根据权利要求 1-19 中任一项的式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物接触。
26. 种子,包含至少一种根据权利要求 1-19 中任一项的式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物。
27. 根据权利要求 1-19 中任一项的式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物在动物中和动物上防治寄生虫的用途。
28. 一种处理或保护动物以防被寄生虫侵染或感染的方法,包括对动物口服、局部或胃肠外给药或施用杀寄生虫有效量的至少一种根据权利要求 1-19 中任一项的式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物。
29. 一种制备用于处理或保护动物以防被寄生虫侵染或感染的组合物的方法,包括将杀寄生虫有效量的至少一种根据权利要求 1-19 中任一项的式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物和至少一种固体载体混合。
30. 根据权利要求 1-19 中任一项的式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物在制备用于处理或保护动物以防寄生虫侵染或感染的药物中的用途。
31. 根据权利要求 1-19 中任一项的式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物,作为药物。
32. 一种制备根据权利要求 1-19 中任一项的式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物的方法,包括使式 (XI) 化合物:



其中 Y 如式 (I) 中所定义;

与式 (XII) 化合物任选在碱存在下反应的步骤:



其中  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $Q$  和  $p$  如式 (I) 中所定义；以及  $L$  为离去基团。



## 用于防治动物害虫的丙二腈化合物

[0001] 本发明涉及芳基烷基丙二腈、其制备方法及其在防治动物害虫中的用途，一种包含所述丙二腈的农业组合物或种子，一种防治动物害虫的方法，一种保护作物以防动物害虫侵袭或侵染的方法，一种保护种子以防土壤昆虫并保护秧苗的根和芽以防土壤和叶面昆虫的方法。

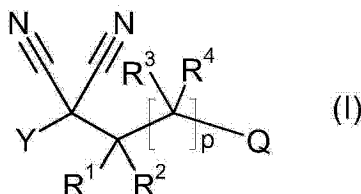
[0002] 动物害虫破坏生长和收获的作物且袭击木质居住和商业结构体，从而对食物供应和财产造成大的经济损失。尽管已知大量杀害虫剂，但由于目标害虫能够对所述杀害虫剂产生耐药性，仍然需要用于防治动物害虫的新试剂。具体而言，动物害虫如昆虫和螨科难以有效防治。然而，提供至少在一些方面优于已知化合物的其他杀害虫化合物为持续目标。

[0003] 具有二氰基链烷结构部分的杀害虫化合物已经公开在许多专利申请中，例如 JP 2002 284608, WO 02/089579, WO 02/090320, WO 02/090321, WO 04/006677, WO 04/020399, JP 2004 99593, JP 2004 99597, WO 05/068432, WO 05/064823, EP 1555259, WO 05/063694, WO 2007/071609 和 WO 2007/147888。

[0004] 现已发现在上述烷基上带有额外额外 6 员芳族杂环的特殊芳基烷基丙二腈尤其可以用于防治害虫，尤其是无脊椎动物害虫。

[0005] 因此，在本发明的一个方面，提供了式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物：

[0006]



[0007] 其中

[0008] Y 为未被取代或被 1、2、3、4 或 5 个取代基  $R^5$  取代的苯基；或为未被取代或被 1、2、3、4、5、6 或 7 个取代基  $R^5$  取代的萘基；

[0009] Q 为在环中含有 1、2、3 或 4 个氮原子的 6 员芳族杂环，其中上述环未被取代或被 1、2、3 或 4 个取代基  $R^6$  取代；

[0010]  $R^1$  为氢、卤素、氰基、羟基、 $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_2$ - $C_6$  链烯基、 $C_2$ - $C_6$  炔基、 $C_3$ - $C_8$  环烷基、 $C_3$ - $C_8$  环烯基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基、 $C_2$ - $C_6$  链烯氧基、 $C_1$ - $C_6$  烷硫基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧羰基，其中上述脂族或脂环族基团的碳原子未被取代或被 1、2 或 3 个取代基  $R^7$  取代；

[0011]  $R^2$  为氢或卤素；或者

[0012]  $R^1$  和  $R^2$  与它们所连接的碳原子一起形成亚甲基或环丙基；

[0013]  $R^3$  为氢、卤素、氰基、羟基、 $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_2$ - $C_6$  链烯基、 $C_2$ - $C_6$  炔基、 $C_3$ - $C_8$  环烷基、 $C_3$ - $C_8$  环烯基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基、 $C_2$ - $C_6$  链烯氧基、 $C_1$ - $C_6$  烷硫基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧羰基，其中上述脂族或脂环族基团的碳原子未被取代或被 1、2 或 3 个取代基  $R^7$  取代；

[0014]  $R^4$  为氢或卤素；或者

[0015]  $R^3$  和  $R^4$  与它们所连接的碳原子一起形成亚甲基或环丙基；

[0016]  $R^5$ 、 $R^6$  各自独立地为卤素、氰基、叠氮基、硝基、 $-SCN$ 、 $SF_5$ 、 $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_2$ - $C_6$  链烯基、

$C_2-C_6$ 炔基,其中上述脂族基团的碳原子未被取代或被一个或多个  $R^a$  取代;

[0017]  $C_3-C_8$ 环烷基或  $C_3-C_8$ 环烯基,其中上述脂环族基团的碳原子未被取代或被一个或多个  $R^b$  取代;

[0018] 未被取代或被至多 5 个  $R^c$  取代的苯基;

[0019] 含有 1、2 或 3 个选自 N、O、S、NO、SO、SO<sub>2</sub> 的杂原子或杂原子基团的 3、4、5、6 或 7 员饱和、部分不饱和或芳族杂环,其中上述环未被取代或被至多 5 个  $R^d$  取代;

[0020]  $Si(R^e)_3$ 、 $OR^f$ 、 $SR^f$ 、 $OS(O)_xR^h$ 、 $S(O)_xR^h$ 、 $N(R^i)_2$ 、 $N(R^i)C(=O)R^m$ 、 $OC(=O)R^m$ 、 $C(=O)R^m$ 、 $C(=O)OR^f$ 、 $C(=NR^i)R^m$ 、 $C(=S)R^m$ ;或者

[0021] 在两个存在于一个苯基环上的相邻碳原子上的两个  $R^5$  一起为选自  $CH_2CH_2CH_2CH_2$ 、 $N=CH-CH=CH$ 、 $CH=CH=CH$ 、 $CH=N-CH=CH$ 、 $N=CH-N=CH$ 、 $N=CH-CH=N$ 、 $OCH_2CH_2CH_2$ 、 $OCH=CHCH_2$ 、 $CH_2OCH_2CH_2$ 、 $OCH_2CH_2O$ 、 $OCH_2OCH_2$ 、 $CH_2CH_2CH_2$ 、 $CH=CHCH_2$ 、 $CH_2CH_2O$ 、 $CH=CHO$ 、 $CH_2OCH_2$ 、 $CH_2C(=O)O$ 、 $C(=O)OCH_2$ 、 $O(CH_2)O$ 、 $SCH_2CH_2CH_2$ 、 $SCH=CHCH_2$ 、 $CH_2SCH_2CH_2$ 、 $SCH_2CH_2S$ 、 $SCH_2SCH_2$ 、 $CH_2CH_2S$ 、 $CH=CHS$ 、 $CH_2SCH_2$ 、 $CH_2C(=S)S$ 、 $C(=S)SCH_2$ 、 $S(CH_2)S$ 、 $CH_2CH_2NR^k$ 、 $CH_2CH=N$ 、 $CH=CH-NR^k$ 、 $OCH=N$ 、 $SCH=N$  的桥并且与这两个  $R^5$  键合的碳原子一起形成 5 或 6 员部分不饱和或芳族碳环或杂环,其中该环未被取代或被 1 或 2 个选自  $=O$ 、 $OH$ 、 $CH_3$ 、 $OCH_3$ 、卤素、卤代甲基和卤代甲氧基的取代基取代;优选一起为选自  $CH_2CH_2CH_2CH_2$ 、 $N=CH-CH=CH$ 、 $CH=CH=CH$ 、 $CH=N-CH=CH$ 、 $N=CH-N=CH$ 、 $OCH_2CH_2CH_2$ 、 $OCH=CHCH_2$ 、 $CH_2OCH_2CH_2$ 、 $OCH_2CH_2O$ 、 $OCH_2OCH_2$ 、 $CH_2CH_2CH_2$ 、 $CH=CHCH_2$ 、 $CH_2CH_2O$ 、 $CH=CHO$ 、 $CH_2OCH_2$ 、 $CH_2C(=O)O$ 、 $C(=O)OCH_2$ 、 $O(CH_2)O$ 、 $SCH_2CH_2CH_2$ 、 $SCH=CHCH_2$ 、 $CH_2SCH_2CH_2$ 、 $SCH_2CH_2S$ 、 $SCH_2SCH_2$ 、 $CH_2CH_2S$ 、 $CH=CHS$ 、 $CH_2SCH_2$ 、 $CH_2C(=S)S$ 、 $C(=S)SCH_2$ 、 $S(CH_2)S$ 、 $CH_2CH_2NR^k$ 、 $CH_2CH=N$ 、 $CH=CH-NR^k$ 、 $OCH=N$ 、 $SCH=N$  的桥并且与这两个  $R^5$  键合的碳原子一起形成 5 或 6 员部分不饱和或芳族碳环或杂环,其中该环未被取代或被 1 或 2 个选自  $=O$ 、 $OH$ 、 $CH_3$ 、 $OCH_3$ 、卤素、卤代甲基和卤代甲氧基的取代基取代;

[0022]  $R^7$  各自独立地为卤素、氰基、羟基、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_3-C_8$ 环烷基、 $C_3-C_8$ 环烯基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_2-C_6$ 链烯氧基、 $C_1-C_6$ 烷硫基、 $C_1-C_6$ 烷氧羰基、 $OSi(R^e)_3$ ,其中上述脂族或脂环族基团的碳原子未被取代、部分或完全被卤代和/或被氧化;

[0023]  $R^a$  各自独立地为卤素、氰基、叠氮基、硝基、 $-SCN$ 、 $SF_5$ 、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1-C_6$ 烷硫基、 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ 卤代烷硫基、 $C_3-C_8$ 环烷基、 $C_3-C_8$ 卤代环烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_2-C_6$ 卤代链烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_2-C_6$ 卤代炔基、 $C_1-C_6$ 烷基- $C_3-C_8$ 环烷基,

[0024]  $Si(R^e)_3$ 、 $OR^A$ 、 $SR^A$ 、 $OSO_2R^B$ 、 $S(O)_xR^B$ 、 $-S(O)_xN(R^D)_2$ 、 $N(R^D)_2$ 、 $C(=O)N(R^D)_2$ 、 $C(=S)N(R^D)_2$ 、 $C(=O)OR^A$ ,

[0025] 未被取代或被至多 5 个  $R^E$  取代的苯基;

[0026] 含有 1、2 或 3 个选自 N、O、S、NO、SO、SO<sub>2</sub> 的杂原子或杂原子基团的 3、4、5、6 或 7 员饱和、部分不饱和或芳族杂环,其中上述环未被取代或被至多 5 个  $R^E$  取代,或者

[0027] 存在于一个碳原子上的两个  $R^a$  一起为  $=O$ 、 $=C(R^F)_2$ 、 $=NR^D$ 、 $=NOR^A$ 、 $=NNR^D$ ,或者

[0028] 两个  $R^a$  与这两个  $R^a$  所键合的碳原子一起形成 3、4、5、6、7 或 8 员饱和或部分不饱和和碳环或杂环;

[0029]  $R^b$  各自独立地为卤素、氰基、叠氮基、硝基、 $-SCN$ 、 $SF_5$ 、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1-C_6$ 烷硫基、 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_6$

卤代烷硫基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>卤代环烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基，

[0030] Si(R<sup>G</sup>)<sub>3</sub>、OR<sup>H</sup>、SR<sup>H</sup>、OSO<sub>2</sub>R<sup>J</sup>、S(O)<sub>x</sub>R<sup>J</sup>、-S(O)<sub>x</sub>N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、C(=S)N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)OR<sup>H</sup>，或者

[0031] 存在于一个碳原子上的两个 R<sup>b</sup>一起为=O、=C(R<sup>L</sup>)<sub>2</sub>、=NR<sup>K</sup>、=NOR<sup>H</sup>、=NNR<sup>K</sup>，或者

[0032] 两个 R<sup>b</sup>与这两个 R<sup>b</sup>所键合的碳原子一起形成 3、4、5、6、7 或 8 员饱和或部分不饱和和碳环或杂环；

[0033] R<sup>c</sup>各自独立地为卤素、氰基、叠氮基、硝基、-SCN、SF<sub>5</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基，其中上述脂族或脂环族基团的碳原子未被取代或被一个或多个 R<sup>M</sup>取代；

[0034] Si(R<sup>G</sup>)<sub>3</sub>、OR<sup>H</sup>、SR<sup>H</sup>、OS(O)<sub>x</sub>R<sup>J</sup>、S(O)<sub>x</sub>R<sup>J</sup>、-S(O)<sub>x</sub>N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>N</sup>、C(=O)OR<sup>H</sup>、C(=NR<sup>K</sup>)R<sup>N</sup>、C(=O)N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、C(=S)N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>；

[0035] R<sup>d</sup>各自独立地为卤素、氰基、叠氮基、硝基、-SCN、SF<sub>5</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基，其中上述脂族或脂环族基团的碳原子未被取代或被一个或多个 R<sup>M</sup>取代；

[0036] Si(R<sup>G</sup>)<sub>3</sub>、OR<sup>H</sup>、SR<sup>H</sup>、OS(O)<sub>x</sub>R<sup>J</sup>、S(O)<sub>x</sub>R<sup>J</sup>、-S(O)<sub>x</sub>N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>N</sup>、C(=O)OR<sup>H</sup>、C(=NR<sup>K</sup>)R<sup>N</sup>、C(=O)N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>、C(=S)N(R<sup>K</sup>)<sub>2</sub>，或者

[0037] 两个存在于饱和或部分不饱和杂环的一个原子上的 R<sup>d</sup>一起为=O、=C(R<sup>L</sup>)<sub>2</sub>、=NR<sup>K</sup>、=NOR<sup>H</sup>或=NNR<sup>K</sup>；

[0038] R<sup>e</sup>各自独立地为卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>卤代环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基烷基，

[0039] 苯基、含有 1、2 或 3 个选自 N、O、S、NO、SO、SO<sub>2</sub>的杂原子或杂原子基团的 3、4、5、6 或 7 员饱和、部分不饱和或芳族杂环；

[0040] R<sup>f</sup>各自独立地为氢、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基，其中上述脂族或脂环族基团的碳原子未被取代或被一个或多个 R<sup>M</sup>取代；

[0041] Si(R<sup>e</sup>)<sub>3</sub>、S(O)<sub>x</sub>R<sup>B</sup>、-S(O)<sub>x</sub>N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、-N=C(R<sup>F</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>Q</sup>、C(=O)N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=S)N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)OR<sup>A</sup>，

[0042] 苯基、含有 1、2 或 3 个选自 N、O、S、NO、SO、SO<sub>2</sub>的杂原子或杂原子基团的 3、4、5、6 或 7 员饱和、部分不饱和或芳族杂环；

[0043] R<sup>h</sup>各自独立地为氢、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基，其中上述脂族或脂环族基团的碳原子未被取代或被一个或多个 R<sup>M</sup>取代；

[0044] N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、-N=C(R<sup>F</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)R<sup>Q</sup>、C(=O)N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=S)N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)OR<sup>A</sup>，苯基、含有 1、2 或 3 个选自 N、O、S、NO、SO、SO<sub>2</sub>的杂原子或杂原子基团的 3、4、5、6 或 7 员饱和、部分不饱和或芳族杂环；

[0045] R<sup>i</sup>各自独立地为氢、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基，其中上述脂族或脂环族基团的碳原子未被取代或被一个或多个 R<sup>M</sup>取代；

[0046]  $S(O)_xR^B$ 、 $-S(O)_xN(R^D)_2$ 、 $C(=O)R^S$ 、 $C(=O)OR^A$ 、 $C(=O)N(R^D)_2$ 、 $C(=S)R^S$ 、 $C(=S)SR^A$ 、 $C(=S)N(R^D)_2$ 、 $C(=NR^D)R^S$ ，

[0047] 未被取代或被至多 5 个  $R^E$  取代的苯基；

[0048] 含有 1、2 或 3 个选自 N、O、S、NO、SO、SO<sub>2</sub> 的杂原子或杂原子基团的 3、4、5、6 或 7 员饱和、部分不饱和或芳族杂环，其中上述环未被取代或被至多 5 个  $R^E$  取代，或者

[0049] 两个在一个氮原子上的  $R^i$  一起为 C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub> 亚烷基链且与它们所键合的氮原子一起形成 3、4、5、6、7 或 8 员饱和、部分不饱和或芳族环，其中亚烷基链可以含有 1 或 2 个选自 N、O、S、NO、SO、SO<sub>2</sub> 的杂原子或杂原子基团并且其中亚烷基链未被取代或被卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 卤代链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 卤代炔基取代；

[0050]  $R^m$  各自独立地为氢、-SCN、SF<sub>5</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷硫基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基，其中上述脂族或脂环族基团的碳原子未被取代或被一个或多个  $R^m$  取代；

[0051]  $Si(R^e)_3$ 、OR<sup>A</sup>、SR<sup>A</sup>、OSO<sub>2</sub>R<sup>B</sup>、N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=S)N(R<sup>D</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)OR<sup>A</sup>，

[0052] 未被取代或被至多 5 个  $R^E$  取代的苯基；

[0053] 含有 1、2 或 3 个选自 N、O、S、NO、SO、SO<sub>2</sub> 的杂原子或杂原子基团的 3、4、5、6 或 7 员饱和、部分不饱和或芳族杂环，其中上述环未被取代或被至多 5 个  $R^E$  取代；

[0054]  $R^A$  各自独立地为氢、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基磺酰基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基，

[0055] C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基，其中后提到的 4 个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或被氧化和 / 或带有 1 或 2 个选自 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基的基团；

[0056] 苯基、苄基、吡啶基、苯氧基，其中后提到的 4 个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或带有 1、2 或 3 个选自 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷氧基和 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧羰基的取代基；

[0057]  $R^B$  各自独立地为氢、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷硫基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基，

[0058] C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基，其中后提到的 4 个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或被氧化和 / 或带有 1 或 2 个选自 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基的基团；

[0059] 苯基、苄基、吡啶基、苯氧基，其中后提到的 4 个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或带有 1、2 或 3 个选自 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷氧基和 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧羰基的取代基；

[0060]  $R^D$  各自独立地为氢、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷硫基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基，

[0061] C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 环烷基，其中后提到的 4 个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或被氧化和 / 或带有 1 或 2 个选自 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基的基团；

[0062] 苯基、苄基、吡啶基、苯氧基，其中后提到的 4 个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或带有 1、2 或 3 个选自 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 卤代烷氧基和 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧羰基的取代基，或者

[0063] 两个在一个氮原子上的  $R^D$  一起为  $C_2-C_6$  亚烷基链且与它们所键合的氮原子一起形成 3、4、5、6 或 7 员饱和、部分不饱和或芳族环, 其中亚烷基链可以含有 1 或 2 个选自 N、O、S、NO、SO、SO<sub>2</sub> 的杂原子或杂原子基团并且其中亚烷基链未被取代或被卤素、 $C_1-C_4$  卤代烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基或  $C_1-C_4$  卤代烷氧基取代;

[0064]  $R^E$  各自独立地为氰基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  卤代烷氧基、 $C_1-C_6$  烷硫基、 $C_1-C_6$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$  烷基磺酰基、 $C_1-C_6$  卤代烷硫基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基,

[0065]  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  链烯基、 $C_2-C_6$  炔基, 其中后提到的 4 个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或被氧化和 / 或带有 1 或 2 个选自  $C_1-C_4$  烷氧基的基团, 或者

[0066] 两个存在于饱和或部分不饱和杂环的一个原子上的  $R^E$  一起为  $=O$ 、 $=N(C_1-C_6$  烷基)、 $=NO(C_1-C_6$  烷基)、 $=CH(C_1-C_4$  烷基) 或  $=C(C_1-C_4$  烷基) $C_1-C_4$  烷基;

[0067]  $R^F$  各自独立地为  $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_6$  环烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基烷基、苯基或苄基;

[0068]  $R^G$  各自独立地为卤素、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_6$  卤代烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基烷基、 $C_2-C_6$  链烯基、 $C_2-C_6$  卤代链烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_2-C_6$  卤代炔基、 $C_1-C_6$  卤代烷氧基烷基;

[0069]  $R^H$  各自独立地为氢、氰基、 $C_1-C_6$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$  烷基磺酰基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基,

[0070]  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  链烯基、 $C_2-C_6$  炔基, 其中后提到的 3 个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或被氧化和 / 或带有 1 或 2 个选自  $C_1-C_4$  烷氧基的基团;

[0071]  $R^J$  各自独立地为氢、氰基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  卤代烷氧基、 $C_1-C_6$  烷硫基、 $C_1-C_6$  卤代烷硫基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基,

[0072]  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  链烯基、 $C_2-C_6$  炔基, 其中后提到的 3 个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或被氧化和 / 或带有 1 或 2 个选自  $C_1-C_4$  烷氧基的基团;

[0073]  $R^K$  各自独立地为氢、氰基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  卤代烷氧基、 $C_1-C_6$  烷硫基、 $C_1-C_6$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$  烷基磺酰基、 $C_1-C_6$  卤代烷硫基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基,

[0074]  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  链烯基、 $C_2-C_6$  炔基, 其中后提到的 3 个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或被氧化和 / 或带有 1 或 2 个选自  $C_1-C_4$  烷氧基的基团;

[0075]  $R^L$  各自独立地为  $C_1-C_4$  烷基或  $C_1-C_4$  烷氧基烷基;

[0076]  $R^M$  各自独立地为卤素、氰基、叠氮基、硝基、OH、SH、-SCN、SF<sub>5</sub>、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  卤代烷氧基、 $C_1-C_6$  烷硫基、 $C_1-C_6$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$  烷基磺酰基、 $C_1-C_6$  卤代烷硫基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基,

[0077]  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  链烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_8$  环烷基、 $C_1-C_6$  烷基- $C_3-C_8$  环烷基, 其中后提到的 5 个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或被氧化和 / 或带有 1 或 2 个选自  $C_1-C_4$  烷氧基的基团, 或者

[0078] 存在于一个碳原子上的两个  $R^M$  一起为  $=O$ 、 $=CH(C_1-C_4$  烷基)、 $=C(C_1-C_4$  烷基) $C_1-C_4$  烷基、 $=N(C_1-C_6$  烷基) 或  $=NO(C_1-C_6$  烷基);

[0079]  $R^N$  各自独立地为氢、OH、SH、-SCN、SF<sub>5</sub>、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  卤代烷氧基、 $C_1-C_6$  烷硫基、 $C_1-C_6$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$  烷基磺酰基、 $C_1-C_6$  卤代烷硫基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基,

[0080]  $C_1-C_6$ 烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_2-C_6$ 炔基，其中后提到的 3 个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或被氧化和 / 或带有 1 或 2 个选自  $C_1-C_4$ 烷氧基的基团；

[0081]  $R^Q$ 各自独立地为氢、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1-C_6$ 烷硫基、 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ 卤代烷硫基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基，

[0082]  $C_1-C_6$ 烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_3-C_8$ 环烷基，其中后提到的 4 个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或被氧化和 / 或带有 1 或 2 个选自  $C_1-C_4$ 烷氧基的基团；

[0083] 苯基、苄基、吡啶基、苯氧基，其中后提到的 4 个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或带有 1、2 或 3 个选自  $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基和  $C_1-C_6$ 烷氧羰基的取代基；

[0084]  $R^S$ 各自独立地为氢、OH、SH、-SCN、 $SF_5$ 、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1-C_6$ 烷硫基、 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ 卤代烷硫基、三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基，

[0085]  $C_1-C_6$ 烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_3-C_8$ 环烷基，其中后提到的 4 个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或被氧化和 / 或带有 1 或 2 个选自  $C_1-C_4$ 烷氧基的基团；

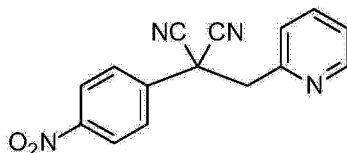
[0086] 苯基、苄基、吡啶基、苯氧基，其中后提到的 4 个基团未被取代、部分或完全被卤代和 / 或带有 1、2 或 3 个选自  $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1-C_6$ 烷氧羰基、 $C_1-C_6$ 烷基氨基和二- $C_1-C_6$ 烷基氨基的取代基；

[0087] p 为 0 或 1；

[0088] x 为 1 或 2，

[0089] 条件是排除下列化合物：

[0090]



[0091] 在本发明的另一方面，提供了一种包含至少一种本发明式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物的农业和 / 或兽用组合物。在优选实施方案中，所述组合物进一步包含至少一种惰性液体和 / 或至少一种固体载体。

[0092] 在本发明的再一方面，提供了本发明式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物在防治动物害虫中的用途。

[0093] 在本发明的再一方面，提供了一种防治动物害虫的方法，包括使动物害虫、其栖息地、繁殖地、食物供应源，其中害虫生长或可能生长的植物、种子、土壤、区域、材料或环境，或者要防止动物侵袭或侵染的材料、植物、种子、土壤、表面或空间与杀虫有效量的至少一种本发明式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物接触。

[0094] 在本发明的再一方面，提供了一种保护作物以防动物害虫侵袭或侵染的方法，包括使作物与杀虫有效量的至少一种本发明式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物接触。

[0095] 在本发明的另一方面，提供了一种保护种子以防土壤昆虫以及保护秧苗的根和芽以防土壤和叶面昆虫的方法，包括在播种之前和 / 或在预萌发之后使种子与至少一种本发

明式 (I) 化合物或其盐或 N- 氧化物接触。

[0096] 在本发明的再一方面, 提供了包含至少一种本发明式 (I) 化合物或其盐或 N- 氧化物的种子。

[0097] 在本发明的另一方面, 提供了本发明式 (I) 化合物或其盐或 N- 氧化物在动物中和动物上防治寄生虫的用途。

[0098] 在本发明的再一方面, 提供了一种处理或保护动物以防被寄生虫侵染或感染的方法, 包括对该动物口服、局部或胃肠外给药或施用杀寄生虫有效量的至少一种本发明式 (I) 化合物或其盐或 N- 氧化物。

[0099] 在本发明的另一方面, 提供了一种制备用于处理或保护动物以防被寄生虫侵染或感染的组合物的方法, 包括将杀寄生虫有效量的至少一种本发明式 (I) 化合物或其盐或 N- 氧化物和至少一种固体载体混合。

[0100] 在本发明的再一方面, 提供了本发明式 (I) 化合物或其盐或 N- 氧化物在制备用于处理或保护动物以防寄生虫侵染或感染的药物中的用途。

[0101] 在本发明的另一方面, 提供了作为药物的式 (I) 化合物或其盐或 N- 氧化物。

[0102] 在本发明的再一方面, 提供了一种制备本发明式 (I) 化合物或其盐或 N- 氧化物的方法, 包括使式 (XI) 化合物:

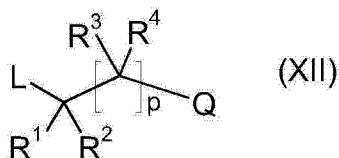
[0103]



[0104] 其中 Y 如式 (I) 中所定义;

[0105] 与式 (XII) 化合物任选在碱存在下反应的步骤:

[0106]



[0107] 其中  $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、Q 和 p 如式 (I) 中所定义; 以及

[0108] L 为离去基团。

[0109] 本发明还涉及植物繁殖材料, 尤其是种子, 包含至少一种式 I 化合物或其盐或 N- 氧化物。

[0110] 本发明化合物包括式 (I) 化合物, 为式 (I) 化合物的盐的化合物, 为式 (I) 化合物的 N- 氧化物的化合物以及同时为式 (I) 化合物的盐和 N- 氧化物的化合物。

[0111] 本发明涉及式 I 化合物的每一可能立体异构体, 即单一对映体或非对映体, 及其混合物。

[0112] 本发明化合物可以是无定形的或者可以以一种或多种可能具有不同宏观性能如稳定性或显示不同生物学性能如活性的不同结晶状态 (多晶形) 或晶型存在。本发明包括无定形和结晶的式 I 化合物二者、相应化合物 I 的不同结晶状态或晶型的混合物及其无定形或结晶盐。

[0113] 式 I 化合物的盐优选为可农用盐和 / 或可兽用盐。它们可以常规方式形成, 例如

若式 I 化合物具有碱性官能团,则通过使该化合物与所述阴离子的酸反应,或者若式 I 化合物具有酸性官能团,则使该化合物与合适的碱反应。

[0114] 合适的可农用或可兽用盐尤其是其阳离子和阴离子分别对本发明化合物的作用没有任何不利影响的那些阳离子的盐或那些酸的酸加成盐。合适的阳离子尤其是碱金属离子,优选锂、钠和钾离子;碱土金属离子,优选钙、镁和钡离子;过渡金属离子,优选锰、铜、锌和铁离子;还有铵离子( $\text{NH}_4^+$ )和其中 1-4 个氢原子被  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 羟基烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、羟基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、苯基或苄基替代的取代铵离子。取代铵离子的实例包括甲基铵、异丙基铵、二甲基铵、二异丙基铵、三甲基铵、四甲基铵、四乙基铵、四丁基铵、2-羟基乙基铵、2-(2-羟基乙氧基)乙基铵、二(2-羟基乙基)铵、苄基三甲基铵和苄基三乙基铵,此外还有磷离子,铈离子,优选三( $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基)铈,以及氧化铈离子,优选三( $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基)氧化铈。

[0115] 有用酸加成盐的阴离子主要是氯离子、溴离子、氟离子、硫酸氢根、硫酸根、磷酸二氢根、磷酸氢根、磷酸根、硝酸根、碳酸氢根、碳酸根、六氟硅酸根、六氟磷酸根、苯甲酸根和  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 链烷酸的阴离子,优选甲酸根、乙酸根、丙酸根和丁酸根。它们可以通过使式 I 化合物与对应阴离子的酸,优选盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸或硝酸反应而形成。

[0116] 式 I 化合物的 N-氧化物可以以常规方式形成,例如通过用合适氧化剂处理式 I 化合物。合适氧化剂的实例包括过氧化氢、脲过氧化氢(UHP)、间氯过苯甲酸(mCPBA)、过硼酸钠、过碳酸钠。

[0117] 在各变量的上述定义中提到的有机结构部分象术语卤素一样为各基团成员的各次列举的集合性术语。前缀  $\text{C}_n$ - $\text{C}_m$ 在每种情况下表示该基团中可能的碳原子数。

[0118] 本文所用术语“卤素”在每种情况下表示氟、氯、溴和碘。

[0119] 本文所用术语“部分或完全被卤代”是指给定基团的一个或多个,例如 1、2、3、4 或 5 个或所有氢原子已经被卤原子,尤其是氟或氯替代。

[0120] 本文所用(以及还有在  $\text{C}_n$ - $\text{C}_m$ 烷基氨基、二- $\text{C}_n$ - $\text{C}_m$ 烷基氨基、 $\text{C}_n$ - $\text{C}_m$ 烷基氨基羰基、二- $\text{C}_n$ - $\text{C}_m$ 烷基氨基羰基、 $\text{C}_n$ - $\text{C}_m$ 烷基硫基、 $\text{C}_n$ - $\text{C}_m$ 烷基亚磺酰基和  $\text{C}_n$ - $\text{C}_m$ 烷基磺酰基中)的术语“ $\text{C}_n$ - $\text{C}_m$ 烷基”是指具有 n-m 个,例如 1-10 个,优选 1-6 个碳原子的支化或未支化饱和烃基,例如甲基、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、1-乙基-2-甲基丙基、庚基、辛基、2-乙基己基、壬基和癸基及其异构体。 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基例如是指甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基或 1,1-二甲基乙基。

[0121] 本文所用(以及还有在  $\text{C}_n$ - $\text{C}_m$ 卤代烷基亚磺酰基和  $\text{C}_n$ - $\text{C}_m$ 卤代烷基磺酰基中)的术语“ $\text{C}_n$ - $\text{C}_m$ 卤代烷基”是指具有 n-m 个,例如 1-10 个,优选 1-6 个碳原子的直链或支化烷基(如上所述),其中这些基团中的部分或所有氢原子可以被如上所述的卤原子替代,例如  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 卤代烷基,如氯甲基、溴甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯一氟甲基、一氯二氟甲基、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、五氟乙基等。术语  $C_1-C_{10}$  卤代烷基尤其包括  $C_1-C_2$  氟烷基, 其与其中 1、2、3、4 或 5 个氢原子被氟原子替代的甲基或乙基是同义词, 如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、1- 氟乙基、2- 氟乙基、2, 2- 二氟乙基、2, 2, 2- 三氟乙基和五氟甲基。

[0122] 类似地, “ $C_n-C_m$  烷氧基” 和 “ $C_n-C_m$  烷硫基” (或  $C_n-C_m$  烷基硫基) 是指分别通过氧或硫键在烷基中的任何键处键合的具有  $n-m$  个, 例如 1-10 个, 尤其是 1-6 个或 1-4 个碳原子的直链或支化烷基 (如上所述)。实例包括  $C_1-C_4$  烷氧基如甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基和叔丁氧基, 此外还有  $C_1-C_4$  烷硫基如甲硫基、乙硫基、丙硫基、异丙硫基和正丁硫基。

[0123] 因此, 术语 “ $C_n-C_m$  卤代烷氧基” 和 “ $C_n-C_m$  卤代烷硫基” (或  $C_n-C_m$  卤代烷基硫基) 是指分别通过氧或硫键在烷基中的任何键处键合的具有  $n-m$  个, 例如 1-10 个, 尤其是 1-6 个或 1-4 个碳原子的直链或支化烷基 (如上所述), 其中这些基团中的部分或所有氢原子可以被上述卤原子替代, 例如  $C_1-C_2$  卤代烷氧基, 如氯甲氧基、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、二氯一氟甲氧基、一氯二氟甲氧基、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- 三氯乙氧基和五氟乙氧基, 此外还有  $C_1-C_2$  卤代烷硫基, 如氯甲硫基、溴甲硫基、二氯甲硫基、三氯甲硫基、氟甲硫基、二氟甲硫基、三氟甲硫基、氯氟甲硫基、二氯一氟甲硫基、一氯二氟甲硫基、1- 氯乙硫基、1- 溴乙硫基、1- 氟乙硫基、2- 氟乙硫基、2, 2- 二氟乙硫基、2, 2, 2- 三氟乙硫基、2- 氯 -2- 氟乙硫基、2- 氯 -2, 2- 二氟乙硫基、2, 2- 二氯 -2- 氟乙硫基、2, 2, 2- 三氯乙硫基和五氟乙硫基等。类似地, 术语 “ $C_1-C_2$  氟烷氧基” 和 “ $C_1-C_2$  氟烷硫基” 是指分别经由氧原子或硫原子与该分子的其余部分键合的  $C_1-C_2$  氟烷基。

[0124] 本文所用术语 “ $C_2-C_m$  链烯基” 是指具有  $2-m$  个, 例如 2-10 个或 2-6 个碳原子和在任意位置的双键的支化或未支化不饱和烃基, 如乙烯基、1- 丙烯基、2- 丙烯基、1- 甲基乙烯基、1- 丁烯基、2- 丁烯基、3- 丁烯基、1- 甲基 -1- 丙烯基、2- 甲基 -1- 丙烯基、1- 甲基 -2- 丙烯基、2- 甲基 -2- 丙烯基、1- 戊烯基、2- 戊烯基、3- 戊烯基、4- 戊烯基、1- 甲基 -1- 丁烯基、2- 甲基 -1- 丁烯基、3- 甲基 -1- 丁烯基、1- 甲基 -2- 丁烯基、2- 甲基 -2- 丁烯基、3- 甲基 -2- 丁烯基、1- 甲基 -3- 丁烯基、2- 甲基 -3- 丁烯基、3- 甲基 -3- 丁烯基、1, 1- 二甲基 -2- 丙烯基、1, 2- 二甲基 -1- 丙烯基、1, 2- 二甲基 -2- 丙烯基、1- 乙基 -1- 丙烯基、1- 乙基 -2- 丙烯基、1- 己烯基、2- 己烯基、3- 己烯基、4- 己烯基、5- 己烯基、1- 甲基 -1- 戊烯基、2- 甲基 -1- 戊烯基、3- 甲基 -1- 戊烯基、4- 甲基 -1- 戊烯基、1- 甲基 -2- 戊烯基、2- 甲基 -2- 戊烯基、3- 甲基 -2- 戊烯基、4- 甲基 -2- 戊烯基、1- 甲基 -3- 戊烯基、2- 甲基 -3- 戊烯基、3- 甲基 -3- 戊烯基、4- 甲基 -3- 戊烯基、1- 甲基 -4- 戊烯基、2- 甲基 -4- 戊烯基、3- 甲基 -4- 戊烯基、4- 甲基 -4- 戊烯基、1, 1- 二甲基 -2- 丁烯基、1, 1- 二甲基 -3- 丁烯基、1, 2- 二甲基 -1- 丁烯基、1, 2- 二甲基 -2- 丁烯基、1, 2- 二甲基 -3- 丁烯基、1, 3- 二甲基 -1- 丁烯基、1, 3- 二甲基 -2- 丁烯基、1, 3- 二甲基 -3- 丁烯基、2, 2- 二甲基 -3- 丁烯基、2, 3- 二甲基 -1- 丁烯基、2, 3- 二甲基 -2- 丁烯基、2, 3- 二甲基 -3- 丁烯基、3, 3- 二甲基 -1- 丁烯基、3, 3- 二甲基 -2- 丁烯基、1- 乙基 -1- 丁烯基、1- 乙基 -2- 丁烯基、1- 乙基 -3- 丁烯基、2- 乙基 -1- 丁烯基、2- 乙基 -2- 丁烯基、2- 乙基 -3- 丁烯基、1, 1, 2- 三甲基 -2- 丙烯基、1- 乙基 -1- 甲基 -2- 丙烯基、1- 乙基 -2- 甲基 -1- 丙烯基和 1- 乙基 -2- 甲基 -2- 丙烯基。

[0125] 本文所用术语“ $C_2-C_m$ 炔基”是指具有  $2-m$  个, 例如  $2-10$  个或  $2-6$  个碳原子且含有至少一个叁键的支化或未支化饱和和炔基, 如乙炔基、丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基等。

[0126] 本文所用术语“ $C_1-C_4$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基”是指具有  $1-4$  个碳原子的烷基, 例如象上述具体实例一样, 其中该烷基的一个氢原子被  $C_1-C_4$ 烷氧基替代。

[0127] 本文所用术语“ $C_3-C_m$ 环烷基”是指  $3-m$  员单环饱和脂环族基团, 例如环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基和环癸基。

[0128] 本文所用术语“芳基”是指芳族烃基如萘基或尤其是苯基。

[0129] 本文所用术语“萘基”是指 1-萘基和 2-萘基。优选萘基为 2-萘基。

[0130] 本文所用术语“ $3-6$  员碳环”是指环丙烷、环丁烷、环戊烷和环己烷环。

[0131] 本文所用术语“含有  $1, 2$  或  $3$  个选自  $N, O, S, NO, SO, SO_2$  的杂原子或杂原子基团的  $3, 4, 5, 6$  或  $7$  员饱和、部分不饱和或芳族杂环”是指单环基团, 该单环基团为饱和、部分不饱和或芳族的。该杂环基团可以经由碳环成员或经由氮环成员与该分子的其余部分连接。

[0132]  $3, 4, 5, 6$  或  $7$  员饱和杂环基或杂环的实例包括: 环氧乙烷基、氮丙啶基、氮杂环丁烷基、2-四氢呋喃基、3-四氢呋喃基、2-四氢噻吩基、3-四氢噻吩基、2-吡咯烷基、3-吡咯烷基、3-吡啶烷基、4-吡啶烷基、5-吡啶烷基、2-咪唑烷基、4-咪唑烷基、2-噁唑烷基、4-噁唑烷基、5-噁唑烷基、3-异噁唑烷基、4-异噁唑烷基、5-异噁唑烷基、2-噻唑烷基、4-噻唑烷基、5-噻唑烷基、3-异噻唑烷基、4-异噻唑烷基、5-异噻唑烷基、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-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-2-基、2-四氢吡喃基、4-四氢吡喃基、1, 3-二噁烷-5-基、1, 4-二噁烷-2-基、2-哌啶基、3-哌啶基、4-哌啶基、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-基和 1, 2, 4-六氢三嗪-3-基、2-吗啉基、3-吗啉基、2-硫代吗啉基、3-硫代吗啉基、1-氧硫代吗啉-2-基、1-氧硫代吗啉-3-基、1, 1-二氧硫代吗啉-2-基、1, 1-二氧硫代吗啉-3-基, 六氢氮杂 $\text{革}$ -1-、-2-、-3-或-4-基, 六氢氧杂环庚三烯基 (oxepinyl)、六氢-1, 3-二氮杂 $\text{革}$ 基、六氢-1, 4-二氮杂 $\text{革}$ 基、六氢-1, 3-氧氮杂 $\text{革}$ 基 (oxazepinyl)、六氢-1, 4-氧氮杂 $\text{革}$ 基、六氢-1, 3-二氧杂环庚三烯基 (dioxepinyl)、六氢-1, 4-二氧杂环庚三烯基等。

[0133]  $3, 4, 5, 6$  或  $7$  员部分不饱和杂环基的实例包括: 2, 3-二氢呋喃-2-基、2, 3-二氢呋喃-3-基、2, 4-二氢呋喃-2-基、2, 4-二氢呋喃-3-基、2, 3-二氢噻吩-2-基、2, 3-二氢噻吩-3-基、2, 4-二氢噻吩-2-基、2, 4-二氢噻吩-3-基、2-吡咯啉-2-基、2-吡咯啉-3-基、3-吡咯啉-2-基、3-吡咯啉-3-基、2-异噁唑啉-3-基、3-异噁唑啉-3-基、4-异噁唑啉-3-基、2-异噁唑啉-4-基、3-异噁唑啉-4-基、4-异噁唑啉-4-基、2-异噁唑啉-5-基、3-异噁唑啉-5-基、4-异噁唑啉-5-基、2-异噻唑啉-3-基、3-异噻唑啉-3-基、4-异噻唑啉-3-基、2-异噻唑啉-4-基、3-异噻唑啉-4-基、4-异噻唑啉-4-基、2-异噻唑啉-5-基、3-异噻唑啉-5-基、4-异噻唑啉-5-基、2, 3-二氢吡啶-1-基、2, 3-二氢吡啶-2-基、2, 3-二氢吡啶-3-基、2, 3-二氢

吡唑-4-基、2,3-二氢吡唑-5-基、3,4-二氢吡唑-1-基、3,4-二氢吡唑-3-基、3,4-二氢吡唑-4-基、3,4-二氢吡唑-5-基、4,5-二氢吡唑-1-基、4,5-二氢吡唑-3-基、4,5-二氢吡唑-4-基、4,5-二氢吡唑-5-基、2,3-二氢噁唑-2-基、2,3-二氢噁唑-3-基、2,3-二氢噁唑-4-基、2,3-二氢噁唑-5-基、3,4-二氢噁唑-2-基、3,4-二氢噁唑-3-基、3,4-二氢噁唑-4-基、3,4-二氢噁唑-5-基、3,4-二氢噁唑-2-基、3,4-二氢噁唑-3-基、3,4-二氢噁唑-4-基、2-,3-,4-,5-或6-二-或四氢吡啶基、3-二-或四氢哒嗪基、4-二-或四氢哒嗪基、2-二-或四氢嘧啶基、4-二-或四氢嘧啶基、5-二-或四氢嘧啶基、二-或四氢吡嗪基、1,3,5-二-或四氢三嗪-2-基、1,2,4-二-或四氢三嗪-3-基、2,3,4,5-四氢[1H]氮杂萘-1-,2-,3-,4-,5-,6-或-7-基,3,4,5,6-四氢[2H]氮杂萘-2-,3-,4-,5-,6-或-7-基,2,3,4,7-四氢[1H]氮杂萘-1-,2-,3-,4-,5-,6-或-7-基,2,3,6,7-四氢[1H]氮杂萘-1-,2-,3-,4-,5-,6-或-7-基,四氢氧杂环庚三烯基,如2,3,4,5-四氢[1H]氧杂环庚三烯-2-,3-,4-,5-,6-或-7-基,2,3,4,7-四氢[1H]氧杂环庚三烯-2-,3-,4-,5-,6-或-7-基,2,3,6,7-四氢[1H]氧杂环庚三烯-2-,3-,4-,5-,6-或-7-基,四氢-1,3-二氮杂萘基,四氢-1,4-二氮杂萘基,四氢-1,3-氧氮杂萘基,四氢-1,4-氧氮杂萘基,四氢-1,3-二氧杂环庚三烯基和四氢-1,4-二氧杂环庚三烯基。

[0134] 3,4,5,6或7员芳族杂环基是5或6员芳族杂环基(杂芳基)。实例是2-咪唑基、3-咪唑基、2-噁吩基、3-噁吩基、2-吡咯基、3-吡咯基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡唑基、2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基、2-咪唑基、4-咪唑基、1,3,4-三唑-2-基、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-嘧啶基和2-吡嗪基。

[0135] 本文所用术语“在环中含有1,2,3或4个氮原子的6员芳族杂环”是指吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、哒嗪基、三嗪基和四嗪基,优选吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、哒嗪基和三嗪基,更优选吡啶基、嘧啶基、吡嗪基和哒嗪基,甚至更优选吡啶基和嘧啶基。

[0136] 本文所用术语“在环中含有1,2或3个氮原子的6员芳族杂环”是指吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、哒嗪基和三嗪基,优选吡啶基、嘧啶基、吡嗪基和哒嗪基,更优选吡啶基和嘧啶基。

[0137] 本文所用术语“吡啶基”是指2-吡啶基、3-吡啶基和4-吡啶基,优选2-吡啶基和3-吡啶基。

[0138] 本文所用术语“嘧啶基”是指2-嘧啶基、4-嘧啶基和5-嘧啶基,优选2-嘧啶基和5-嘧啶基。

[0139] 本文所用术语“吡嗪基”是指2-吡嗪基。

[0140] 本文所用术语“哒嗪基”是指3-哒嗪基和4-哒嗪基,优选3-哒嗪基。

[0141] 本文所用术语“三嗪基”是指1,2,3-三嗪-4-基、1,2,3-三嗪-5-基、1,2,4-三嗪-3-基、1,2,4-三嗪-5-基、1,2,4-三嗪-6-基和1,3,5-三嗪-2-基,优选1,2,3-三

嗪-4-基、1,2,4-三嗪-3-基和1,2,4-三嗪-6-基。

[0142] 本文所用术语“四嗪基”是指1,2,4,5-四嗪-3-基。

[0143] 环Q经由其碳原子之一（不是经由氮原子）键合于式(I)化合物的其余部分。存在的话，取代基 $R^6$ 键合于含于环Q中的碳原子（不是氮原子）。不用说环Q上可能取代基 $R^6$ 的数目由含与环Q中的N原子数限制。在含于环Q中的N原子数为1时，取代基 $R^6$ 的最大可能数目为4；在含于环Q中的N原子数为2时，取代基 $R^6$ 的最大可能数目为3；在含于环Q中的N原子数为3时，取代基 $R^6$ 的最大可能数目为2；在含于环Q中的N原子数为4时，取代基 $R^6$ 的最大可能数目为1。

[0144] 本文所用术语“ $C_2$ - $C_7$ 亚烷基”是具有2-7个碳原子的二价支化或优选未支化饱和脂族链，例如 $CH_2CH_2$ 、 $-CH(CH_3)-$ 、 $CH_2CH_2CH_2$ 、 $CH(CH_3)CH_2$ 、 $CH_2CH(CH_3)$ 、 $CH_2CH_2CH_2CH_2$ 、 $CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$ 、 $CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$ 和 $CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$ 。

[0145] 本文所用术语“三- $C_1$ - $C_4$ 甲硅烷基- $C_2$ - $C_4$ 炔基”是指被三- $C_1$ - $C_4$ 甲硅烷基取代的 $C_2$ - $C_4$ 炔基。本文所用术语“（三甲基甲硅烷基）乙炔基”是指被三甲基甲硅烷基取代的乙炔基。

[0146] 本文所用术语“ $C_1$ - $C_6$ 烷基- $C_3$ - $C_8$ 环烷基”是指被 $C_1$ - $C_6$ 烷基取代的 $C_3$ - $C_8$ 环烷基。本文所用术语“ $C_1$ - $C_4$ 烷基- $C_3$ - $C_6$ 环烷基”是指被 $C_1$ - $C_4$ 烷基取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基。

[0147] 优选术语“未被取代或被1、2、3、4或5个取代基 $R^5$ 取代的苯基”是指“被至多3个或者在卤素的情况下被至多最大可能数目的取代基 $R^5$ 取代的苯基”，以及优选“未被取代或被1、2、3或4个取代基 $R^5$ 取代的苯基”，更优选“未被取代或被1、2或3个取代基 $R^5$ 取代的苯基”，甚至更优选“未被取代或被1或2个取代基 $R^5$ 取代的苯基”以及特别优选“未被取代或被1个取代基 $R^5$ 取代的苯基”。

[0148] 优选术语“未被取代或被1、2、3、4、5、6或7个取代基 $R^5$ 取代的萘基”是指“未被取代或被至多3个或者在卤素的情况下被至多最大可能数目的取代基 $R^5$ 取代的萘基”，更优选“未被取代或被至多3个取代基 $R^5$ 取代的萘基”，甚至更优选“未被取代或被至多2个取代基 $R^5$ 取代的萘基”以及特别优选“未被取代或被至多1个取代基 $R^5$ 取代的萘基”。

[0149] 优选术语“未被取代或被1、2、3或4个取代基 $R^6$ 取代”是指“未被取代或被1、2或3个取代基 $R^6$ 取代”，更优选“未被取代或被1或2个取代基 $R^6$ 取代”，甚至更优选“未被取代或被1个取代基 $R^6$ 取代”。

[0150] 优选例如与苯基或杂环相关的术语“未被取代或被至多5个 $R^c/R^d/R^E$ 取代”是指“未被取代或被至多3个或者在卤素的情况下被至多最大可能数目的 $R^c/R^d/R^E$ 取代”，更优选“未被取代或被至多2个或者在卤素的情况下被至多最大可能数目的 $R^c/R^d/R^E$ 取代”，还更优选“未被取代或被至多3个 $R^c/R^d/R^E$ 取代”，甚至更优选“未被取代或被至多2个 $R^c/R^d/R^E$ 取代”。

[0151] 优选例如与取代基 $R^a$ 、 $R^b$ 或 $R^M$ 相关的术语“未被取代或被取代一次或多次”是指“未被取代或被至多5个或者在卤素的情况下被至多最大可能数目的取代基取代”，更优选“未被取代或被至多3个或者在卤素的情况下被至多最大可能数目的取代基取代”，甚至更优选“未被取代或被至多2个或者在卤素的情况下被至多最大可能数目的取代基取代”，还更优选“未被取代或被至多5个取代基取代”，还甚至更优选“未被取代或被至多3个取代基取代”，特别优选“未被取代或被至多2个取代基取代”。

[0152] 本文所述的优选、更优选、甚至更优选和特别优选取代基和实施方案应理解为相互独立地或者以每一可能的相互组合是优选的。

[0153] 这些优选情形和实施方案适用于本发明化合物、本发明化合物的用途以及使用本发明化合物的方法。

[0154] 优选如下式 (I) 化合物, 其中 Y 为未被取代或被 1、2、3 或 4 个取代基  $R^5$  取代的苯基; 或未被取代或被 1 或 2 个取代基  $R^5$  取代的萘基。

[0155] 优选如下式 (I) 化合物, 其中 Q 为在环中含有 1、2 或 3 个氮原子的 6 员芳族杂环, 其中上述环未被取代或被 1、2、3 或 4 个取代基  $R^6$  取代。

[0156] 优选如下式 (I) 化合物, 其中  $R^1$  为 H、卤素、氰基、 $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_2$ - $C_6$  链烯基、 $C_2$ - $C_6$  炔基、 $C_3$ - $C_6$  环烷基或  $C_1$ - $C_6$  烷氧羰基, 其中后提到的 5 个基团未被取代或被 1、2 或 3 个选自卤素、氰基、羟基、 $OSi(C_1-C_6 \text{ 烷基})_3$ 、 $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_2$ - $C_6$  链烯基、 $C_2$ - $C_6$  炔基、 $C_3$ - $C_6$  环烷基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基和  $C_1$ - $C_6$  烷氧羰基的取代基取代, 后提到的 6 个基团未被取代或部分或完全被卤代, 尤其是如下那些, 其中  $R^1$  为 H、Me、Et、iPr、cPr、 $CH_2CN$ 、 $CF_3$ 、 $CHF_2$ 、 $CH_2F$ 、 $CH_2CH_2F$ 、 $CH_2CHF_2$ 、 $CH_2CF_3$ 、CN、卤素、 $CH_2OH$ 、 $CH_2OMe$ 、 $CH_2OEt$ 、 $CO_2Me$ 、 $CO_2Et$ 、 $CH_2CO_2Me$ 、 $CH_2CO_2Et$ 、 $CH_2OSi(Me)_3$  或  $CH_2OSi(Et)_3$ 。

[0157] 优选其中  $R^2$  为 H 或卤素的式 (I) 化合物。

[0158] 还优选其中  $R^1$  和  $R^2$  与它们所连接的碳原子一起形成亚甲基的式 (I) 化合物。

[0159] 优选如下式 (I) 化合物, 其中  $R^3$  为 H、卤素、氰基、 $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_2$ - $C_6$  链烯基、 $C_2$ - $C_6$  炔基、 $C_3$ - $C_6$  环烷基或  $C_1$ - $C_6$  烷氧羰基, 其中后提到的 5 个基团未被取代或被 1、2 或 3 个选自卤素、氰基、羟基、 $OSi(C_1-C_6 \text{ 烷基})_3$ 、 $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_2$ - $C_6$  链烯基、 $C_2$ - $C_6$  炔基、 $C_3$ - $C_6$  环烷基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基和  $C_1$ - $C_6$  烷氧羰基的取代基取代, 后提到的 6 个基团未被取代或部分或完全被卤代, 尤其是如下那些, 其中  $R^3$  为 H、Me、Et、iPr、cPr、 $CH_2CN$ 、 $CF_3$ 、 $CHF_2$ 、 $CH_2F$ 、 $CH_2CH_2F$ 、 $CH_2CHF_2$ 、 $CH_2CF_3$ 、CN、卤素、 $CH_2OH$ 、 $CH_2OMe$ 、 $CH_2OEt$ 、 $CO_2Me$ 、 $CO_2Et$ 、 $CH_2CO_2Me$ 、 $CH_2CO_2Et$ 、 $CH_2OSi(Me)_3$  或  $CH_2OSi(Et)_3$ 。

[0160] 优选其中  $R^4$  为 H 或卤素的式 (I) 化合物。

[0161] 还优选其中  $R^3$  和  $R^4$  与它们所连接的碳原子一起形成亚甲基的式 (I) 化合物。

[0162] 优选如下式 (I) 化合物, 其中  $R^5$  为卤素、氰基、 $SF_5$ 、三- $C_1$ - $C_4$  甲硅烷基- $C_2$ - $C_4$  炔基、 $C_1$ - $C_6$  烷基氨基羰基、二- $C_1$ - $C_6$  烷基氨基羰基、 $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_2$ - $C_6$  链烯基、 $C_2$ - $C_6$  炔基、 $C_3$ - $C_6$  环烷基、苯基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基、 $C_1$ - $C_6$  烷硫基、 $C_1$ - $C_6$  烷基亚磺酰基、 $C_1$ - $C_6$  烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧羰基、 $C_1$ - $C_6$  烷基氨基、二- $C_1$ - $C_6$  烷基氨基、 $C_1$ - $C_6$  烷基羰基或  $C_1$ - $C_6$  烷基羰氧基, 其中后提到的 14 个基团未被取代或被一个或多个 (特别是至多 3 个或者在卤素的情况下至多最大可能数目) 选自卤素、氰基、 $C_1$ - $C_4$  烷基- $C_3$ - $C_6$  环烷基、 $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_2$ - $C_6$  链烯基、 $C_2$ - $C_6$  炔基、 $C_3$ - $C_6$  环烷基和  $C_1$ - $C_6$  烷氧基的取代基取代, 其中后提到的 5 个基团未被取代或部分或完全被卤代, 尤其是如下那些, 其中  $R^5$  为卤素 (特别是 F)、Me、Et、iPr、cPr、OMe、OEt、OiPr、乙炔基、(三甲基甲硅烷基) 乙炔基、乙烯基、Ph、CN、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $SF_5$ 、 $CHF_2$ 、 $OCHF_2$ 、SMe、S(O)Me、S(O) $_2$ Me、 $SCF_3$ 、S(O) $CF_3$ 、S(O) $_2CF_3$ 、 $SCHF_2$ 、S(O) $CHF_2$ 、S(O) $_2CHF_2$ 、 $CO_2Me$ 、 $CO_2Et$ 、C(O)Me、OAc、C(O)NMe、C(O)NMe $_2$ 、 $CH_2OMe$  或  $CH_2OEt$ 。

[0163] 优选如下式 (I) 化合物, 其中  $R^6$  为卤素、氰基、 $SF_5$ 、三- $C_1$ - $C_4$  甲硅烷基- $C_2$ - $C_4$  炔基、 $C_1$ - $C_6$  烷基氨基羰基、二- $C_1$ - $C_6$  烷基氨基羰基、 $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_2$ - $C_6$  链烯基、 $C_2$ - $C_6$  炔基、 $C_3$ - $C_6$  环

烷基、苯基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基亚磺酰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧羰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基、二- $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基或 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰氧基，其中后提到的14个基团未被取代或被一个或多个（特别是至多3个或者在卤素的情况下至多最大可能数目）选自卤素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基- $C_3$ - $C_6$ 环烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_2$ - $C_6$ 链烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基和 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基的取代基取代，其中后提到的5个基团未被取代或部分或完全被卤代，尤其是如下那些，其中 $R^6$ 为卤素（特别是F）、Me、Et、iPr、cPr、OMe、OEt、OiPr、乙炔基、（三甲基甲硅烷基）乙炔基、乙烯基、Ph、CN、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $SF_5$ 、 $CHF_2$ 、 $OCHF_2$ 、SMe、S(O)Me、S(O)<sub>2</sub>Me、 $SCF_3$ 、S(O)CF<sub>3</sub>、S(O)<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、SCHF<sub>2</sub>、S(O)CHF<sub>2</sub>、S(O)<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>Me、CO<sub>2</sub>Et、C(O)Me、OAc、C(O)NHMe、C(O)NMe<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>OMe或CH<sub>2</sub>OEt。

[0164] 还优选如下式(I)化合物，其中 $R^5$ 为卤素、Me、Et、iPr、cPr、OMe、OEt、OiPr、乙炔基、（三甲基甲硅烷基）乙炔基、乙烯基、Ph、CN、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $SF_5$ 、 $CHF_2$ 、 $OCHF_2$ 、SMe、S(O)Me、S(O)<sub>2</sub>Me、 $SCF_3$ 、S(O)CF<sub>3</sub>、S(O)<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、SCHF<sub>2</sub>、S(O)CHF<sub>2</sub>、S(O)<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>Me、CO<sub>2</sub>Et、C(O)Me、OAc、C(O)NHMe、C(O)NMe<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>OMe或CH<sub>2</sub>OEt；或者在两个存在于一个苯基环上的相邻碳原子上的两个 $R^5$ 一起为选自N=CH-CH=CH、N=CH-CH=N、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O、O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O的桥并且与这两个 $R^5$ 键合的碳原子一起形成5或6员部分不饱和或芳族杂环，其中该环未被取代。

[0165] 优选其中p为0或1的式(I)化合物，尤其是其中p为0的那些。

[0166] 更优选其中Y为未被取代或被1、2或3个取代基 $R^5$ 取代的苯基；或未被取代或被1个取代基 $R^5$ 取代的萘基的式(I)化合物。

[0167] 更优选其中Q为在环中含有1、2或3个氮原子的6员芳族杂环的式(I)化合物，其中上述环未被取代或被1、2或3个取代基 $R^6$ 取代。

[0168] 更优选其中 $R^1$ 为H、Me、Et、CN、CH<sub>2</sub>CN、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、卤素、CH<sub>2</sub>OH、CH<sub>2</sub>OMe、CH<sub>2</sub>OEt、CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、CH<sub>2</sub>OSi(Me)<sub>3</sub>或CH<sub>2</sub>OSi(Et)<sub>3</sub>的式(I)化合物。

[0169] 更优选其中 $R^2$ 为H或卤素的式(I)化合物。

[0170] 更优选其中 $R^3$ 为H、Me、Et、CN、CH<sub>2</sub>CN、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、卤素、CH<sub>2</sub>OH、CH<sub>2</sub>OMe、CH<sub>2</sub>OEt、CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、CH<sub>2</sub>OSi(Me)<sub>3</sub>或CH<sub>2</sub>OSi(Et)<sub>3</sub>的式(I)化合物。

[0171] 更优选其中 $R^4$ 为H或卤素的式(I)化合物。

[0172] 更优选如下式(I)化合物，其中 $R^5$ 为卤素、氰基、三- $C_1$ - $C_4$ 甲硅烷基- $C_2$ - $C_4$ 炔基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_2$ - $C_6$ 链烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基、苯基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基或 $C_1$ - $C_6$ 烷氧羰基，其中后提到的8个基团未被取代或部分或完全被卤代，尤其是如下那些，其中 $R^5$ 为卤素（特别是Cl、F）、Me、OMe、CN、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 或乙炔基。

[0173] 更优选如下式(I)化合物，其中 $R^6$ 为卤素、氰基、三- $C_1$ - $C_4$ 甲硅烷基- $C_2$ - $C_4$ 炔基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_2$ - $C_6$ 链烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基、苯基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基或 $C_1$ - $C_6$ 烷氧羰基，其中后提到的8个基团未被取代或部分或完全被卤代，尤其是如下那些，其中 $R^6$ 为卤素（特别是Cl、F）、Me、OMe、CN、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 或乙炔基。

[0174] 更优选其中p为0或1的式(I)化合物，尤其是其中p为0的那些。

[0175] 甚至更优选其中Y为未被取代或被1或2个取代基 $R^5$ 取代的苯基的式(I)化合物。

[0176] 甚至更优选其中Q为吡啶基、嘧啶基、吡嗪基或哒嗪基，其中上述环未被取代或被1或2个取代基 $R^6$ 取代的式(I)化合物，尤其是其中Q为吡啶基、嘧啶基、吡嗪基或哒嗪基，

其中上述环未被取代或被 1 个取代基  $R^6$  取代的那些。

[0177] 甚至更优选其中  $R^1$  为 H、F、Me、Et、CN、 $\text{CH}_2\text{CN}$  或  $\text{CH}_2\text{OMe}$  的式 (I) 化合物, 尤其是其中  $R^1$  为 H 的那些。

[0178] 甚至更优选其中  $R^2$  为 H 的式 (I) 化合物。

[0179] 甚至更优选其中  $R^3$  为 H、F、Me、Et、CN、 $\text{CH}_2\text{CN}$  或  $\text{CH}_2\text{OMe}$  的式 (I) 化合物, 尤其是其中  $R^3$  为 H 的那些。

[0180] 甚至更优选其中  $R^4$  为 H 的式 (I) 化合物。

[0181] 甚至更优选其中  $R^5$  为 F、Cl、CN、乙炔基、Me、OMe 或  $\text{CF}_3$  的式 (I) 化合物, 尤其是其中  $R^5$  为 F 的那些。

[0182] 甚至更优选其中  $R^6$  为 F、乙炔基、Br 或  $\text{CF}_3$  的式 (I) 化合物。

[0183] 甚至更优选其中  $p$  为 0 或 1 的式 (I) 化合物, 尤其是其中  $p$  为 0 的那些。

[0184] 还优选其中所有符号和指数具有优选含义的式 (I) 化合物。

[0185] 还更优选其中所有符号和指数具有更优选含义的式 (I) 化合物。

[0186] 还甚至更优选其中所有符号和指数具有甚至更优选含义的式 (I) 化合物。

[0187] 优选如下式 (I) 化合物, 其中

[0188] Y 为未被取代或被 1、2、3、4 或 5 个取代基  $R^5$  取代的苯基; 或未被取代或被 1 或 2 个取代基  $R^5$  取代的萘基;

[0189] Q 为在环中含有 1、2 或 3 个氮原子的 6 员芳族杂环, 其中上述环未被取代或被 1、2、3 或 4 个取代基  $R^6$  取代;

[0190]  $R^1$  为 H、卤素、氰基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$  链烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$  炔基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$  环烷基或  $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷氧羰基, 其中后提到的 5 个基团未被取代或被 1、2 或 3 个选自卤素、氰基、羟基、 $\text{OSi}(\text{C}_1\text{-C}_6\text{烷基})_3$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$  链烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$  炔基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$  环烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷氧基和  $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷氧羰基的取代基取代, 其中后提到的 6 个基团未被取代或部分或完全被卤代;

[0191]  $R^2$  为 H 或卤素; 或者

[0192]  $R^1$  和  $R^2$  与它们所连接的碳原子一起形成亚甲基;

[0193]  $R^3$  为 H、卤素、氰基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$  链烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$  炔基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$  环烷基或  $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷氧羰基, 其中后提到的 5 个基团未被取代或被 1、2 或 3 个选自卤素、氰基、羟基、 $\text{OSi}(\text{C}_1\text{-C}_6\text{烷基})_3$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$  链烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$  炔基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$  环烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷氧基和  $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷氧羰基的取代基取代, 其中后提到的 6 个基团未被取代或部分或完全被卤代;

[0194]  $R^4$  为 H 或卤素; 或者

[0195]  $R^3$  和  $R^4$  与它们所连接的碳原子一起形成亚甲基;

[0196]  $R^5$  为卤素、氰基、 $\text{SF}_5$ 、三- $\text{C}_1\text{-C}_4$  甲硅烷基- $\text{C}_2\text{-C}_4$  炔基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷基氨基羰基、二- $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷基氨基羰基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$  链烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$  炔基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$  环烷基、苯基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷硫基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷基亚磺酰基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷基磺酰基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷氧羰基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷基氨基、二- $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷基氨基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷基羰基或  $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷基羰氧基, 其中后提到的 14 个基团未被取代或被一个或多个选自卤素、氰基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$  烷基- $\text{C}_3\text{-C}_6$  环烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$  链烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$  炔基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$  环烷基和  $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷氧基的取代基取代, 其中后提到的 5 个基团未被取代或部分或完全被卤代; 或者

[0197] 在两个存在于一个苯基环上的相邻碳原子上的两个  $R^5$  一起为选自  $\text{N}=\text{CH}-\text{CH}=\text{$

CH、N = CH-CH = N、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O、O(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub> 的桥并且与这两个 R<sup>5</sup>键合的碳原子一起形成 5 或 6 员部分不饱和或芳族杂环，其中该环未被取代；

[0198] R<sup>6</sup>为卤素、氰基、SF<sub>5</sub>、三-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>甲硅烷基-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、苯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰氧基，其中后提到的 14 个基团未被取代或被一个或多个选自卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基和 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基的取代基取代，其中后提到的 5 个基团未被取代或部分或完全被卤代；

[0199] p 为 0 或 1。

[0200] 还优选如下式 (I) 化合物，其中

[0201] Y 为未被取代或被 1、2、3 或 4 个取代基 R<sup>5</sup>取代的苯基；或未被取代或被 1 或 2 个取代基 R<sup>5</sup>取代的萘基；

[0202] Q 为在环中含有 1、2 或 3 个氮原子的 6 员芳族杂环，其中上述环未被取代或被 1、2、3 或 4 个取代基 R<sup>6</sup>取代；

[0203] R<sup>1</sup>为 H、卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基，其中后提到的 5 个基团未被取代或被 1、2 或 3 个选自卤素、氰基、羟基、OSi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)<sub>3</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基和 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基的取代基取代，其中后提到的 6 个基团未被取代或部分或完全被卤代；

[0204] R<sup>2</sup>为 H 或卤素；或者

[0205] R<sup>1</sup>和 R<sup>2</sup>与它们所连接的碳原子一起形成亚甲基；

[0206] R<sup>3</sup>为 H、卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基，其中后提到的 5 个基团未被取代或被 1、2 或 3 个选自卤素、氰基、羟基、OSi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)<sub>3</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基和 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基的取代基取代，其中后提到的 6 个基团未被取代或部分或完全被卤代；

[0207] R<sup>4</sup>为 H 或卤素；或者

[0208] R<sup>3</sup>和 R<sup>4</sup>与它们所连接的碳原子一起形成亚甲基；

[0209] R<sup>5</sup>为卤素、氰基、SF<sub>5</sub>、三-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>甲硅烷基-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、苯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰氧基，其中后提到的 14 个基团未被取代或被一个或多个选自卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基和 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基的取代基取代，其中后提到的 5 个基团未被取代或部分或完全被卤代；

[0210] R<sup>6</sup>为卤素、氰基、SF<sub>5</sub>、三-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>甲硅烷基-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、苯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰氧基，其中后提到的 14 个基团未被取代或被一个或多个选自卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基和 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基的取代基取代，其中后提到的 5 个基团未被取代或部分或完全被卤代；

[0211] p 为 0 或 1。



[0212] 更优选如下式 (I) 化合物, 其中

[0213] Y 为未被取代或被 1、2、3、4 或 5 个取代基  $R^5$  取代的苯基; 或未被取代或被 1 个取代基  $R^5$  取代的萘基;

[0214] Q 为在环中含有 1、2 或 3 个氮原子的 6 员芳族杂环, 其中上述环未被取代或被 1、2 或 3 个取代基  $R^6$  取代;

[0215]  $R^1$  为 H、Me、Et、CN、 $CH_2CN$ 、 $CH_2CF_3$ 、卤素、 $CH_2OH$ 、 $CH_2OMe$ 、 $CH_2OEt$ 、 $CH_2CO_2Me$ 、 $CH_2CO_2Et$ 、 $CH_2OSi(Me)_3$  或  $CH_2OSi(Et)_3$ ;

[0216]  $R^2$  为 H 或卤素;

[0217]  $R^3$  为 H、Me、Et、CN、 $CH_2CN$ 、 $CH_2CF_3$ 、卤素、 $CH_2OH$ 、 $CH_2OMe$ 、 $CH_2OEt$ 、 $CH_2CO_2Me$ 、 $CH_2CO_2Et$ 、 $CH_2OSi(Me)_3$  或  $CH_2OSi(Et)_3$ ;

[0218]  $R^4$  为 H 或卤素;

[0219]  $R^5$  为卤素、氰基、三  $-C_1-C_4$  甲硅烷基  $-C_2-C_4$  炔基、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  链烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_6$  环烷基、苯基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  烷硫基或  $C_1-C_6$  烷氧羰基, 其中后提到的 8 个基团未被取代或部分或完全被卤代; 或者

[0220] 在两个存在于一个苯基环上的相邻碳原子上的两个  $R^5$  一起为选自  $N=CH-CH=CH$ 、 $N=CH-CH=N$ 、 $OCH_2CH_2O$ 、 $O(CH_2)_2O$  的桥并且与这两个  $R^5$  键合的碳原子一起形成 5 或 6 员部分不饱和或芳族杂环, 其中该环未被取代;

[0221]  $R^6$  为卤素、氰基、三  $-C_1-C_4$  甲硅烷基  $-C_2-C_4$  炔基、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  链烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_6$  环烷基、苯基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  烷硫基或  $C_1-C_6$  烷氧羰基, 其中后提到的 8 个基团未被取代或部分或完全被卤代;

[0222] p 为 0 或 1。

[0223] 还更优选如下式 (I) 化合物, 其中

[0224] Y 为未被取代或被 1、2 或 3 个取代基  $R^5$  取代的苯基; 或未被取代或被 1 个取代基  $R^5$  取代的萘基;

[0225] Q 为在环中含有 1、2 或 3 个氮原子的 6 员芳族杂环, 其中上述环未被取代或被 1、2 或 3 个取代基  $R^6$  取代;

[0226]  $R^1$  为 H、Me、Et、CN、 $CH_2CN$ 、 $CH_2CF_3$ 、卤素、 $CH_2OH$ 、 $CH_2OMe$ 、 $CH_2OEt$ 、 $CH_2CO_2Me$ 、 $CH_2CO_2Et$ 、 $CH_2OSi(Me)_3$  或  $CH_2OSi(Et)_3$ ;

[0227]  $R^2$  为 H 或卤素;

[0228]  $R^3$  为 H、Me、Et、CN、 $CH_2CN$ 、 $CH_2CF_3$ 、卤素、 $CH_2OH$ 、 $CH_2OMe$ 、 $CH_2OEt$ 、 $CH_2CO_2Me$ 、 $CH_2CO_2Et$ 、 $CH_2OSi(Me)_3$  或  $CH_2OSi(Et)_3$ ;

[0229]  $R^4$  为 H 或卤素;

[0230]  $R^5$  为卤素、氰基、三  $-C_1-C_4$  甲硅烷基  $-C_2-C_4$  炔基、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  链烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_6$  环烷基、苯基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  烷硫基或  $C_1-C_6$  烷氧羰基, 其中后提到的 8 个基团未被取代或部分或完全被卤代;

[0231]  $R^6$  为卤素、氰基、三  $-C_1-C_4$  甲硅烷基  $-C_2-C_4$  炔基、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  链烯基、 $C_2-C_6$  炔基、 $C_3-C_6$  环烷基、苯基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  烷硫基或  $C_1-C_6$  烷氧羰基, 其中后提到的 8 个基团未被取代或部分或完全被卤代;

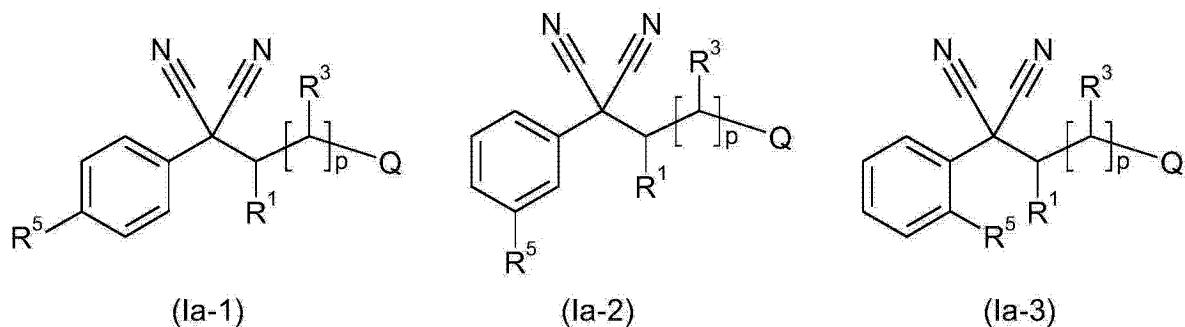
[0232] p 为 0 或 1。

- [0233] 甚至更优选如下式 (I) 化合物, 其中
- [0234] Y 为未被取代或被 1、2 或 3 个取代基  $R^5$  取代的苯基;
- [0235] Q 为吡啶基、嘧啶基、吡嗪基或哒嗪基, 其中上述环未被取代或被 1 或 2 个取代基  $R^6$  取代;
- [0236]  $R^1$  为 H、F、Me、Et、CN、 $CH_2CN$  或  $CH_2OMe$ ;
- [0237]  $R^2$  为 H;
- [0238]  $R^3$  为 H、F、Me、Et、CN、 $CH_2CN$  或  $CH_2OMe$ ;
- [0239]  $R^4$  为 H;
- [0240]  $R^5$  为 F、Cl、CN、乙炔基、Me、OMe 或  $CF_3$ ;
- [0241]  $R^6$  为 F、乙炔基、Br 或  $CF_3$ ;
- [0242] p 为 0 或 1。
- [0243] 还甚至更优选如下式 (I) 化合物, 其中
- [0244] Y 为未被取代或被 1 或 2 个取代基  $R^5$  取代的苯基;
- [0245] Q 为吡啶基、嘧啶基、吡嗪基或哒嗪基, 其中上述环未被取代或被 1 或 2 个取代基  $R^6$  取代的苯基;
- [0246]  $R^1$  为 H、F、Me、Et、CN、 $CH_2CN$  或  $CH_2OMe$ ;
- [0247]  $R^2$  为 H;
- [0248]  $R^3$  为 H、F、Me、Et、CN、 $CH_2CN$  或  $CH_2OMe$ ;
- [0249]  $R^4$  为 H;
- [0250]  $R^5$  为 F、Cl、CN、乙炔基、Me、OMe 或  $CF_3$ ;
- [0251]  $R^6$  为 F、乙炔基、Br 或  $CF_3$ ;
- [0252] p 为 0 或 1。
- [0253] 特别优选其中 Y 为 4- 氟苯基、3- 氟苯基、2- 氟苯基、4- 氯苯基、3- 氰基苯基、4- 乙炔基苯基、3- 甲基苯基、3- 甲氧基苯基、4- 三氟甲基苯基、3, 5- 二氟苯基或 3, 4, 5- 三氟苯基的式 (I) 化合物。
- [0254] 还特别优选其中 Y 为 4- 氟苯基、3- 氟苯基、2- 氟苯基、4- 氯苯基、3- 氰基苯基、4- 乙炔基苯基、3- 甲基苯基、3- 甲氧基苯基、4- 三氟甲基苯基或 3, 5- 二氟苯基的式 (I) 化合物。
- [0255] 还特别优选其中 Y 为 3, 4, 5- 三氟苯基的式 (I) 化合物。
- [0256] 还特别优选其中 Q 为 2- 吡啶基、3- 吡啶基或 5- 嘧啶基, 其中上述环未被取代或被一个或多个  $R^6$  取代, 特别是 2- 吡啶基、3- 吡啶基或 5- 嘧啶基, 其中上述环未被取代或被 1 或 2 个  $R^6$  (特别是 F、乙炔基、Br、 $CF_3$ ) 取代的式 (I) 化合物。
- [0257] 特别优选其中  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  和  $R^4$  为 H 的式 (I) 化合物。
- [0258] 非常特别优选其中  $R^1$  和  $R^2$  为 H 且 p 为 0 的式 (I) 化合物。
- [0259] 在优选实施方案中, Q 为吡啶基或嘧啶基, 其中上述环未被取代或被一个或多个  $R^6$  取代, 特别是吡啶基或嘧啶基, 其中上述环未被取代或被 1 或 2 个  $R^6$  取代。
- [0260] 在一个实施方案中,  $R^1$  和  $R^2$  不与它们所连接的碳原子一起形成亚甲基。
- [0261] 在另一实施方案中,  $R^3$  和  $R^4$  不与它们所连接的碳原子一起形成亚甲基。
- [0262] 在再一实施方案中,  $R^1$  和  $R^2$  以及  $R^3$  和  $R^4$  均不与它们所连接的碳原子一起形成亚

甲基。

[0263] 进一步优选的式 (I) 化合物是式 (Ia-1)、(Ia-2) 或 (Ia-3) 化合物：

[0264]



[0265] 其中 Y 为被 1 个取代基  $R^5$  取代的苯基； $R^2$  为 H； $R^4$  为 H；Q 如式 (I) 中所定义；并且 p、 $R^1$ 、 $R^3$  和  $R^5$  如表 A 中所定义。

[0266] 式 (Ia-1)、(Ia-2) 或 (Ia-3) 化合物包括其中 Y 为未取代苯基的相应化合物。与此一致的是，在表 A 的“ $R^5$ ”栏中符号“-”是指相应化合物不带有取代基  $R^5$ ，即 Y 为未取代的苯基。

[0267] 表 A

[0268]

序号	p	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>
A-001	0	H	—	—
A-002	0	H	—	F
A-003	0	H	—	Cl
A-004	0	H	—	Br
A-005	0	H	—	Me
A-006	0	H	—	Et
A-007	0	H	—	iPr
A-008	0	H	—	cPr
A-009	0	H	—	tBu
A-010	0	H	—	OMe
A-011	0	H	—	OEt
A-012	0	H	—	OiPr
A-013	0	H	—	乙烯基
A-014	0	H	—	乙炔基
A-015	0	H	—	CN
A-016	0	H	—	CF <sub>3</sub>
A-017	0	H	—	OCF <sub>3</sub>
A-018	0	H	—	CHF <sub>2</sub>
A-019	0	H	—	CH <sub>2</sub> F
A-020	0	H	—	OCHF <sub>2</sub>
A-021	0	H	—	OCH <sub>2</sub> F
A-022	1	H	H	—
A-023	1	H	H	F
A-024	1	H	H	Cl

[0269]

A-025	1	H	H	Br
A-026	1	H	H	Me
A-027	1	H	H	Et
A-028	1	H	H	iPr
A-029	1	H	H	cPr
A-030	1	H	H	tBu
A-031	1	H	H	OMe
A-032	1	H	H	OEt
A-033	1	H	H	OiPr
A-034	1	H	H	乙烯基
A-035	1	H	H	乙炔基
A-036	1	H	H	CN
A-037	1	H	H	CF <sub>3</sub>
A-038	1	H	H	OCF <sub>3</sub>
A-039	1	H	H	CHF <sub>2</sub>
A-040	1	H	H	CH <sub>2</sub> F
A-041	1	H	H	OCHF <sub>2</sub>
A-042	1	H	H	OCH <sub>2</sub> F
A-043	0	Me	—	—
A-044	0	Me	—	F
A-045	0	Me	—	Cl
A-046	0	Me	—	Br
A-047	0	Me	—	Me
A-048	0	Me	—	Et
A-049	0	Me	—	iPr
A-050	0	Me	—	cPr
A-051	0	Me	—	tBu
A-052	0	Me	—	OMe
A-053	0	Me	—	OEt
A-054	0	Me	—	OiPr
A-055	0	Me	—	乙烯基
A-056	0	Me	—	乙炔基
A-057	0	Me	—	CN
A-058	0	Me	—	CF <sub>3</sub>
A-059	0	Me	—	OCF <sub>3</sub>
A-060	0	Me	—	CHF <sub>2</sub>
A-061	0	Me	—	CH <sub>2</sub> F
A-062	0	Me	—	OCHF <sub>2</sub>
A-063	0	Me	—	OCH <sub>2</sub> F
A-064	0	Et	—	—

[0270]

A-065	0	Et	—	F
A-066	0	Et	—	Cl
A-067	0	Et	—	Br
A-068	0	Et	—	Me
A-069	0	Et	—	Et
A-070	0	Et	—	iPr
A-071	0	Et	—	cPr
A-072	0	Et	—	tBu
A-073	0	Et	—	OMe
A-074	0	Et	—	OEt
A-075	0	Et	—	OiPr
A-076	0	Et	—	乙烯基
A-077	0	Et	—	乙炔基
A-078	0	Et	—	CN
A-079	0	Et	—	CF <sub>3</sub>
A-080	0	Et	—	OCF <sub>3</sub>
A-081	0	Et	—	CHF <sub>2</sub>
A-082	0	Et	—	CH <sub>2</sub> F
A-083	0	Et	—	OCHF <sub>2</sub>
A-084	0	Et	—	OCH <sub>2</sub> F
A-085	0	CN	—	—
A-086	0	CN	—	F
A-087	0	CN	—	Cl
A-088	0	CN	—	Br
A-089	0	CN	—	Me
A-090	0	CN	—	Et
A-091	0	CN	—	iPr
A-092	0	CN	—	cPr
A-093	0	CN	—	tBu
A-094	0	CN	—	OMe
A-095	0	CN	—	OEt
A-096	0	CN	—	OiPr
A-097	0	CN	—	乙烯基
A-098	0	CN	—	乙炔基
A-099	0	CN	—	CN
A-100	0	CN	—	CF <sub>3</sub>
A-101	0	CN	—	OCF <sub>3</sub>
A-102	0	CN	—	CHF <sub>2</sub>
A-103	0	CN	—	CH <sub>2</sub> F
A-104	0	CN	—	OCHF <sub>2</sub>

[0271]

A-105	0	CN		OCH <sub>2</sub> F
A-106	0	CF <sub>3</sub>		
A-107	0	CF <sub>3</sub>		F
A-108	0	CF <sub>3</sub>		Cl
A-109	0	CF <sub>3</sub>		Br
A-110	0	CF <sub>3</sub>		Me
A-111	0	CF <sub>3</sub>		Et
A-112	0	CF <sub>3</sub>		iPr
A-113	0	CF <sub>3</sub>		cPr
A-114	0	CF <sub>3</sub>		tBu
A-115	0	CF <sub>3</sub>		OMe
A-116	0	CF <sub>3</sub>		OEt
A-117	0	CF <sub>3</sub>		OiPr
A-118	0	CF <sub>3</sub>		乙烯基
A-119	0	CF <sub>3</sub>		乙炔基
A-120	0	CF <sub>3</sub>		CN
A-121	0	CF <sub>3</sub>		CF <sub>3</sub>
A-122	0	CF <sub>3</sub>		OCF <sub>3</sub>
A-123	0	CF <sub>3</sub>		CHF <sub>2</sub>
A-124	0	CF <sub>3</sub>		CH <sub>2</sub> F
A-125	0	CF <sub>3</sub>		OCHF <sub>2</sub>
A-126	0	CF <sub>3</sub>		OCH <sub>2</sub> F
A-127	0	CH <sub>2</sub> CN		
A-128	0	CH <sub>2</sub> CN		F
A-129	0	CH <sub>2</sub> CN		Cl
A-130	0	CH <sub>2</sub> CN		Br
A-131	0	CH <sub>2</sub> CN		Me
A-132	0	CH <sub>2</sub> CN		Et
A-133	0	CH <sub>2</sub> CN		iPr
A-134	0	CH <sub>2</sub> CN		cPr
A-135	0	CH <sub>2</sub> CN		tBu
A-136	0	CH <sub>2</sub> CN		OMe
A-137	0	CH <sub>2</sub> CN		OEt
A-138	0	CH <sub>2</sub> CN		OiPr
A-139	0	CH <sub>2</sub> CN		乙烯基
A-140	0	CH <sub>2</sub> CN		乙炔基
A-141	0	CH <sub>2</sub> CN		CN
A-142	0	CH <sub>2</sub> CN		CF <sub>3</sub>

[0272]

A-143	0	CH <sub>2</sub> CN	—	OCF <sub>3</sub>
A-144	0	CH <sub>2</sub> CN	—	CHF <sub>2</sub>
A-145	0	CH <sub>2</sub> CN	—	CH <sub>2</sub> F
A-146	0	CH <sub>2</sub> CN	—	OCHF <sub>2</sub>
A-147	0	CH <sub>2</sub> CN	—	OCH <sub>2</sub> F
A-148	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	—
A-149	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	F
A-150	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	Cl
A-151	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	Br
A-152	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	Me
A-153	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	Et
A-154	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	iPr
A-155	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	cPr
A-156	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	tBu
A-157	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	OMe
A-158	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	OEt
A-159	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	OiPr
A-160	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	乙烯基
A-161	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	乙炔基
A-162	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	CN
A-163	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	CF <sub>3</sub>
A-164	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	OCF <sub>3</sub>
A-165	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	CHF <sub>2</sub>
A-166	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	CH <sub>2</sub> F
A-167	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	OCHF <sub>2</sub>
A-168	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	OCH <sub>2</sub> F
A-169	1	Me	H	—
A-170	1	Me	H	F
A-171	1	Me	H	Cl
A-172	1	Me	H	Br
A-173	1	Me	H	Me
A-174	1	Me	H	Et
A-175	1	Me	H	iPr
A-176	1	Me	H	cPr
A-177	1	Me	H	tBu
A-178	1	Me	H	OMe
A-179	1	Me	H	OEt
A-180	1	Me	H	OiPr
A-181	1	Me	H	乙烯基

[0273]



A-182	1	Me	H	乙炔基
A-183	1	Me	H	CN
A-184	1	Me	H	CF <sub>3</sub>
A-185	1	Me	H	OCF <sub>3</sub>
A-186	1	Me	H	CHF <sub>2</sub>
A-187	1	Me	H	CH <sub>2</sub> F
A-188	1	Me	H	OCHF <sub>2</sub>
A-189	1	Me	H	OCH <sub>2</sub> F
A-190	1	Et	H	—
A-191	1	Et	H	F
A-192	1	Et	H	Cl
A-193	1	Et	H	Br
A-194	1	Et	H	Me
A-195	1	Et	H	Et
A-196	1	Et	H	iPr
A-197	1	Et	H	cPr
A-198	1	Et	H	tBu
A-199	1	Et	H	OMe
A-200	1	Et	H	OEt
A-201	1	Et	H	OiPr
A-202	1	Et	H	乙烯基
A-203	1	Et	H	乙炔基
A-204	1	Et	H	CN
A-205	1	Et	H	CF <sub>3</sub>
A-206	1	Et	H	OCF <sub>3</sub>
A-207	1	Et	H	CHF <sub>2</sub>
A-208	1	Et	H	CH <sub>2</sub> F
A-209	1	Et	H	OCHF <sub>2</sub>
A-210	1	Et	H	OCH <sub>2</sub> F
A-211	1	CN	H	—
A-212	1	CN	H	F
A-213	1	CN	H	Cl
A-214	1	CN	H	Br
A-215	1	CN	H	Me
A-216	1	CN	H	Et
A-217	1	CN	H	iPr
A-218	1	CN	H	cPr
A-219	1	CN	H	tBu
A-220	1	CN	H	OMe
A-221	1	CN	H	OEt

[0274]

A-222	1	CN	H	OiPr
A-223	1	CN	H	乙烯基
A-224	1	CN	H	乙炔基
A-225	1	CN	H	CN
A-226	1	CN	H	CF <sub>3</sub>
A-227	1	CN	H	OCF <sub>3</sub>
A-228	1	CN	H	CHF <sub>2</sub>
A-229	1	CN	H	CH <sub>2</sub> F
A-230	1	CN	H	OCHF <sub>2</sub>
A-231	1	CN	H	OCH <sub>2</sub> F
A-232	1	CF <sub>3</sub>	H	—
A-233	1	CF <sub>3</sub>	H	F
A-234	1	CF <sub>3</sub>	H	Cl
A-235	1	CF <sub>3</sub>	H	Br
A-236	1	CF <sub>3</sub>	H	Me
A-237	1	CF <sub>3</sub>	H	Et
A-238	1	CF <sub>3</sub>	H	iPr
A-239	1	CF <sub>3</sub>	H	cPr
A-240	1	CF <sub>3</sub>	H	tBu
A-241	1	CF <sub>3</sub>	H	OMe
A-242	1	CF <sub>3</sub>	H	OEt
A-243	1	CF <sub>3</sub>	H	OiPr
A-244	1	CF <sub>3</sub>	H	乙烯基
A-245	1	CF <sub>3</sub>	H	乙炔基
A-246	1	CF <sub>3</sub>	H	CN
A-247	1	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>
A-248	1	CF <sub>3</sub>	H	OCF <sub>3</sub>
A-249	1	CF <sub>3</sub>	H	CHF <sub>2</sub>
A-250	1	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> F
A-251	1	CF <sub>3</sub>	H	OCHF <sub>2</sub>
A-252	1	CF <sub>3</sub>	H	OCH <sub>2</sub> F
A-253	1	CH <sub>2</sub> CN	H	—
A-254	1	CH <sub>2</sub> CN	H	F
A-255	1	CH <sub>2</sub> CN	H	Cl
A-256	1	CH <sub>2</sub> CN	H	Br
A-257	1	CH <sub>2</sub> CN	H	Me
A-258	1	CH <sub>2</sub> CN	H	Et
A-259	1	CH <sub>2</sub> CN	H	iPr

[0275]

A-260	1	CH <sub>2</sub> CN	H	cPr
A-261	1	CH <sub>2</sub> CN	H	tBu
A-262	1	CH <sub>2</sub> CN	H	OMe
A-263	1	CH <sub>2</sub> CN	H	OEt
A-264	1	CH <sub>2</sub> CN	H	OiPr
A-265	1	CH <sub>2</sub> CN	H	乙烯基
A-266	1	CH <sub>2</sub> CN	H	乙炔基
A-267	1	CH <sub>2</sub> CN	H	CN
A-268	1	CH <sub>2</sub> CN	H	CF <sub>3</sub>
A-269	1	CH <sub>2</sub> CN	H	OCF <sub>3</sub>
A-270	1	CH <sub>2</sub> CN	H	CHF <sub>2</sub>
A-271	1	CH <sub>2</sub> CN	H	CH <sub>2</sub> F
A-272	1	CH <sub>2</sub> CN	H	OCHF <sub>2</sub>
A-273	1	CH <sub>2</sub> CN	H	OCH <sub>2</sub> F
A-274	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	—
A-275	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	F
A-276	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	Cl
A-277	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	Br
A-278	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	Me
A-279	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	Et
A-280	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	iPr
A-281	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	cPr
A-282	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	tBu
A-283	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	OMe
A-284	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	OEt
A-285	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	OiPr
A-286	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	乙烯基
A-287	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	乙炔基
A-288	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	CN
A-289	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	CF <sub>3</sub>
A-290	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	OCF <sub>3</sub>
A-291	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	CHF <sub>2</sub>
A-292	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	CH <sub>2</sub> F
A-293	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	OCHF <sub>2</sub>
A-294	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	OCH <sub>2</sub> F
A-295	1	H	Me	—
A-296	1	H	Me	F
A-297	1	H	Me	Cl

[0276]

A-298	1	H	Me	Br
A-299	1	H	Me	Me
A-300	1	H	Me	Et
A-301	1	H	Me	iPr
A-302	1	H	Me	cPr
A-303	1	H	Me	tBu
A-304	1	H	Me	OMe
A-305	1	H	Me	OEt
A-306	1	H	Me	OiPr
A-307	1	H	Me	乙烯基
A-308	1	H	Me	乙炔基
A-309	1	H	Me	CN
A-310	1	H	Me	CF <sub>3</sub>
A-311	1	H	Me	OCF <sub>3</sub>
A-312	1	H	Me	CHF <sub>2</sub>
A-313	1	H	Me	CH <sub>2</sub> F
A-314	1	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
A-315	1	H	Me	OCH <sub>2</sub> F
A-316	1	H	Et	—
A-317	1	H	Et	F
A-318	1	H	Et	Cl
A-319	1	H	Et	Br
A-320	1	H	Et	Me
A-321	1	H	Et	Et
A-322	1	H	Et	iPr
A-323	1	H	Et	cPr
A-324	1	H	Et	tBu
A-325	1	H	Et	OMe
A-326	1	H	Et	OEt
A-327	1	H	Et	OiPr
A-328	1	H	Et	乙烯基
A-329	1	H	Et	乙炔基
A-330	1	H	Et	CN
A-331	1	H	Et	CF <sub>3</sub>
A-332	1	H	Et	OCF <sub>3</sub>
A-333	1	H	Et	CHF <sub>2</sub>
A-334	1	H	Et	CH <sub>2</sub> F
A-335	1	H	Et	OCHF <sub>2</sub>
A-336	1	H	Et	OCH <sub>2</sub> F
A-337	1	H	CN	H

[0277]

A-338	1	H	CN	F
A-339	1	H	CN	Cl
A-340	1	H	CN	Br
A-341	1	H	CN	Me
A-342	1	H	CN	Et
A-343	1	H	CN	iPr
A-344	1	H	CN	cPr
A-345	1	H	CN	tBu
A-346	1	H	CN	OMe
A-347	1	H	CN	OEt
A-348	1	H	CN	OiPr
A-349	1	H	CN	乙烯基
A-350	1	H	CN	乙炔基
A-351	1	H	CN	CN
A-352	1	H	CN	CF <sub>3</sub>
A-353	1	H	CN	OCF <sub>3</sub>
A-354	1	H	CN	CHF <sub>2</sub>
A-355	1	H	CN	CH <sub>2</sub> F
A-356	1	H	CN	OCHF <sub>2</sub>
A-357	1	H	CN	OCH <sub>2</sub> F
A-358	1	H	CF <sub>3</sub>	—
A-359	1	H	CF <sub>3</sub>	F
A-360	1	H	CF <sub>3</sub>	Cl
A-361	1	H	CF <sub>3</sub>	Br
A-362	1	H	CF <sub>3</sub>	Me
A-363	1	H	CF <sub>3</sub>	Et
A-364	1	H	CF <sub>3</sub>	iPr
A-365	1	H	CF <sub>3</sub>	cPr
A-366	1	H	CF <sub>3</sub>	tBu
A-367	1	H	CF <sub>3</sub>	OMe
A-368	1	H	CF <sub>3</sub>	OEt
A-369	1	H	CF <sub>3</sub>	OiPr
A-370	1	H	CF <sub>3</sub>	乙烯基
A-371	1	H	CF <sub>3</sub>	乙炔基
A-372	1	H	CF <sub>3</sub>	CN
A-373	1	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
A-374	1	H	CF <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>
A-375	1	H	CF <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>
A-376	1	H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> F

[0278]

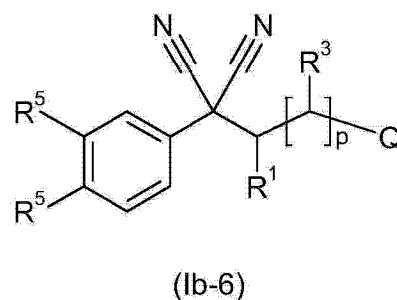
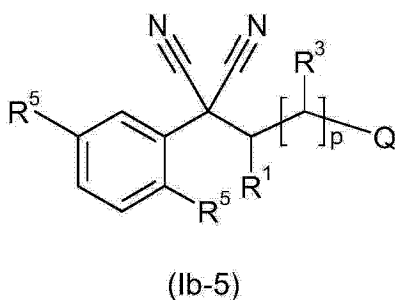
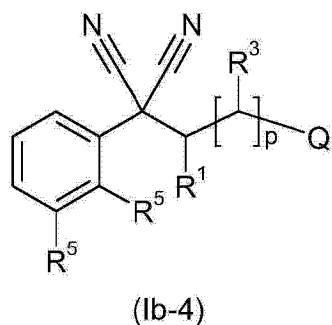
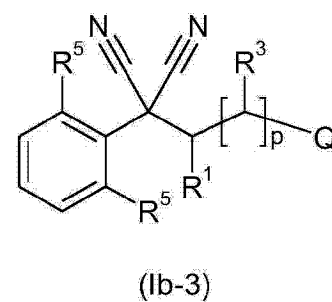
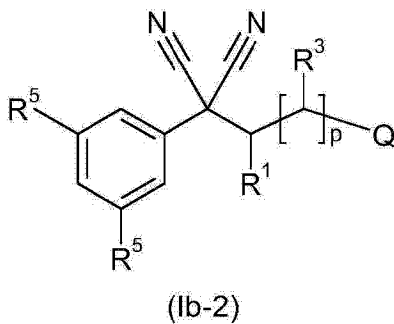
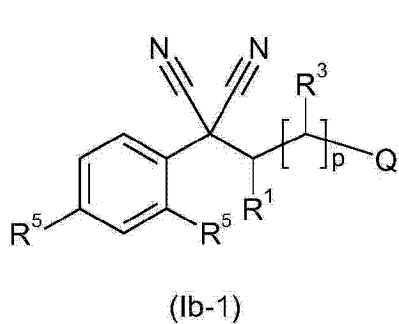
A-377	1	H	CF <sub>3</sub>	OCHF <sub>2</sub>
A-378	1	H	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> F
A-379	1	H	CH <sub>2</sub> CN	-
A-380	1	H	CH <sub>2</sub> CN	F
A-381	1	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl
A-382	1	H	CH <sub>2</sub> CN	Br
A-383	1	H	CH <sub>2</sub> CN	Me
A-384	1	H	CH <sub>2</sub> CN	Et
A-385	1	H	CH <sub>2</sub> CN	iPr
A-386	1	H	CH <sub>2</sub> CN	cPr
A-387	1	H	CH <sub>2</sub> CN	tBu
A-388	1	H	CH <sub>2</sub> CN	OMe
A-389	1	H	CH <sub>2</sub> CN	OEt
A-390	1	H	CH <sub>2</sub> CN	OiPr
A-391	1	H	CH <sub>2</sub> CN	乙烯基
A-392	1	H	CH <sub>2</sub> CN	乙炔基
A-393	1	H	CH <sub>2</sub> CN	CN
A-394	1	H	CH <sub>2</sub> CN	CF <sub>3</sub>
A-395	1	H	CH <sub>2</sub> CN	OCF <sub>3</sub>
A-396	1	H	CH <sub>2</sub> CN	CHF <sub>2</sub>
A-397	1	H	CH <sub>2</sub> CN	CH <sub>2</sub> F
A-398	1	H	CH <sub>2</sub> CN	OCHF <sub>2</sub>
A-399	1	H	CH <sub>2</sub> CN	OCH <sub>2</sub> F
A-400	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	-
A-401	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	F
A-402	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	Cl
A-403	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	Br
A-404	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	Me
A-405	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	Et
A-406	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	iPr
A-407	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	cPr
A-408	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	tBu
A-409	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	OMe
A-410	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	OEt
A-411	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	OiPr
A-412	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	乙烯基
A-413	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	乙炔基
A-414	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	CN

[0279]

<b>A-415</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>
<b>A-416</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>OCF<sub>3</sub></b>
<b>A-417</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>CHF<sub>2</sub></b>
<b>A-418</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>CH<sub>2</sub>F</b>
<b>A-419</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>OCHF<sub>2</sub></b>
<b>A-420</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>OCH<sub>2</sub>F</b>

[0280] 进一步优选的式 (I) 化合物是式 (Ib-1)、(Ib-2)、(Ib-3)、(Ib-4)、(Ib-5) 或 (Ib-6) 化合物：

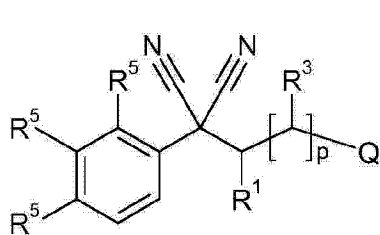
[0281]



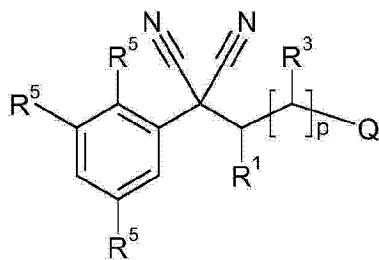
[0282] 其中 Y 为被 2 个取代基 R<sup>5</sup> 取代的苯基；R<sup>2</sup> 为 H；R<sup>4</sup> 为 H；Q 如式 (I) 中所定义；并且 p、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup> 和 R<sup>5</sup> 如表 B 中所定义。

[0283] 进一步优选的式 (I) 化合物为式 (Ib-7)、(Ib-8)、(Ib-9)、(Ib-10)、(Ib-11) 或 (Ib-12) 化合物：

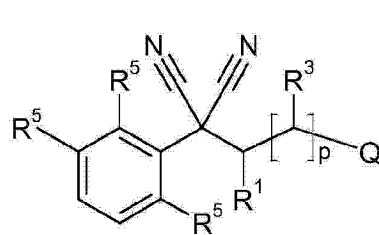
[0284]



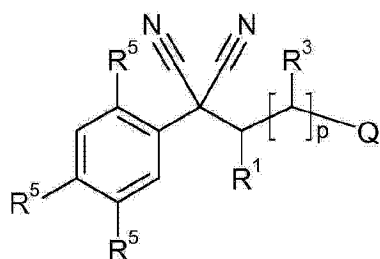
(lb-7)



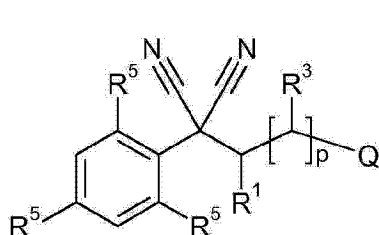
(lb-8)



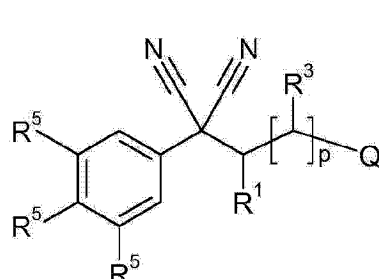
(lb-9)



(lb-10)



(lb-11)



(lb-12)

[0285] 其中Y为被3个取代基R<sup>5</sup>取代的苯基；R<sup>2</sup>为H；R<sup>4</sup>为H；Q如式(I)中所定义；并且p、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>和R<sup>5</sup>如表B中所定义。

[0286] 表B

[0287]

序号	p	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>
B-001	0	H	-	F
B-002	0	H	-	Cl
B-003	0	H	-	Br
B-004	0	H	-	Me
B-005	0	H	-	Et
B-006	0	H	-	iPr
B-007	0	H	-	cPr
B-008	0	H	-	OMe
B-009	0	H	-	OEt
B-010	0	H	-	CF <sub>3</sub>
B-011	0	H	-	OCF <sub>3</sub>
B-012	1	H	H	F
B-013	1	H	H	Cl
B-014	1	H	H	Br
B-015	1	H	H	Me
B-016	1	H	H	Et
B-017	1	H	H	iPr
B-018	1	H	H	cPr
B-019	1	H	H	OMe
B-020	1	H	H	OEt



[0288]

B-021	1	H	H	CF <sub>3</sub>
B-022	1	H	H	OCF <sub>3</sub>
B-023	0	Me	—	F
B-024	0	Me	—	Cl
B-025	0	Me	—	Br
B-026	0	Me	—	Me
B-027	0	Me	—	Et
B-028	0	Me	—	iPr
B-029	0	Me	—	cPr
B-030	0	Me	—	OMe
B-031	0	Me	—	OEt
B-032	0	Me	—	CF <sub>3</sub>
B-033	0	Me	—	OCF <sub>3</sub>
B-034	0	Et	—	F
B-035	0	Et	—	Cl
B-036	0	Et	—	Br
B-037	0	Et	—	Me
B-038	0	Et	—	Et
B-039	0	Et	—	iPr
B-040	0	Et	—	cPr
B-041	0	Et	—	OMe
B-042	0	Et	—	OEt
B-043	0	Et	—	CF <sub>3</sub>
B-044	0	Et	—	OCF <sub>3</sub>
B-045	0	CN	—	F
B-046	0	CN	—	Cl
B-047	0	CN	—	Br
B-048	0	CN	—	Me
B-049	0	CN	—	Et
B-050	0	CN	—	iPr
B-051	0	CN	—	cPr
B-052	0	CN	—	OMe
B-053	0	CN	—	OEt
B-054	0	CN	—	CF <sub>3</sub>
B-055	0	CN	—	OCF <sub>3</sub>
B-056	0	CF <sub>3</sub>	—	F
B-057	0	CF <sub>3</sub>	—	Cl
B-058	0	CF <sub>3</sub>	—	Br
B-059	0	CF <sub>3</sub>	—	Me
B-060	0	CF <sub>3</sub>	—	Et

[0289]

B-061	0	CF <sub>3</sub>	—	iPr
B-062	0	CF <sub>3</sub>	—	cPr
B-063	0	CF <sub>3</sub>	—	OMe
B-064	0	CF <sub>3</sub>	—	OEt
B-065	0	CF <sub>3</sub>	—	CF <sub>3</sub>
B-066	0	CF <sub>3</sub>	—	OCF <sub>3</sub>
B-067	0	CH <sub>2</sub> CN	—	F
B-068	0	CH <sub>2</sub> CN	—	Cl
B-069	0	CH <sub>2</sub> CN	—	Br
B-070	0	CH <sub>2</sub> CN	—	Me
B-071	0	CH <sub>2</sub> CN	—	Et
B-072	0	CH <sub>2</sub> CN	—	iPr
B-073	0	CH <sub>2</sub> CN	—	cPr
B-074	0	CH <sub>2</sub> CN	—	OMe
B-075	0	CH <sub>2</sub> CN	—	OEt
B-076	0	CH <sub>2</sub> CN	—	CF <sub>3</sub>
B-077	0	CH <sub>2</sub> CN	—	OCF <sub>3</sub>
B-078	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	F
B-079	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	Cl
B-080	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	Br
B-081	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	Me
B-082	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	Et
B-083	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	iPr
B-084	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	cPr
B-085	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	OMe
B-086	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	OEt
B-087	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	CF <sub>3</sub>
B-088	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	OCF <sub>3</sub>
B-089	1	Me	H	F
B-090	1	Me	H	Cl
B-091	1	Me	H	Br
B-092	1	Me	H	Me
B-093	1	Me	H	Et
B-094	1	Me	H	iPr
B-095	1	Me	H	cPr
B-096	1	Me	H	OMe
B-097	1	Me	H	OEt
B-098	1	Me	H	CF <sub>3</sub>
B-099	1	Me	H	OCF <sub>3</sub>

[0290]

<b>B-100</b>	<b>1</b>	<b>Et</b>	<b>H</b>	<b>F</b>
<b>B-101</b>	<b>1</b>	<b>Et</b>	<b>H</b>	<b>Cl</b>
<b>B-102</b>	<b>1</b>	<b>Et</b>	<b>H</b>	<b>Br</b>
<b>B-103</b>	<b>1</b>	<b>Et</b>	<b>H</b>	<b>Me</b>
<b>B-104</b>	<b>1</b>	<b>Et</b>	<b>H</b>	<b>Et</b>
<b>B-105</b>	<b>1</b>	<b>Et</b>	<b>H</b>	<b>iPr</b>
<b>B-106</b>	<b>1</b>	<b>Et</b>	<b>H</b>	<b>cPr</b>
<b>B-107</b>	<b>1</b>	<b>Et</b>	<b>H</b>	<b>OMe</b>
<b>B-108</b>	<b>1</b>	<b>Et</b>	<b>H</b>	<b>OEt</b>
<b>B-109</b>	<b>1</b>	<b>Et</b>	<b>H</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>
<b>B-110</b>	<b>1</b>	<b>Et</b>	<b>H</b>	<b>OCF<sub>3</sub></b>
<b>B-111</b>	<b>1</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>	<b>F</b>
<b>B-112</b>	<b>1</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>	<b>Cl</b>
<b>B-113</b>	<b>1</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>	<b>Br</b>
<b>B-114</b>	<b>1</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>	<b>Me</b>
<b>B-115</b>	<b>1</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>	<b>Et</b>
<b>B-116</b>	<b>1</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>	<b>iPr</b>
<b>B-117</b>	<b>1</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>	<b>cPr</b>
<b>B-118</b>	<b>1</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>	<b>OMe</b>
<b>B-119</b>	<b>1</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>	<b>OEt</b>
<b>B-120</b>	<b>1</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>
<b>B-121</b>	<b>1</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>	<b>OCF<sub>3</sub></b>
<b>B-122</b>	<b>1</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>H</b>	<b>F</b>
<b>B-123</b>	<b>1</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>H</b>	<b>Cl</b>
<b>B-124</b>	<b>1</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>H</b>	<b>Br</b>
<b>B-125</b>	<b>1</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>H</b>	<b>Me</b>
<b>B-126</b>	<b>1</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>H</b>	<b>Et</b>
<b>B-127</b>	<b>1</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>H</b>	<b>iPr</b>
<b>B-128</b>	<b>1</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>H</b>	<b>cPr</b>
<b>B-129</b>	<b>1</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>H</b>	<b>OMe</b>
<b>B-130</b>	<b>1</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>H</b>	<b>OEt</b>
<b>B-131</b>	<b>1</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>H</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>
<b>B-132</b>	<b>1</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>H</b>	<b>OCF<sub>3</sub></b>
<b>B-133</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>CN</b>	<b>H</b>	<b>F</b>
<b>B-134</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>CN</b>	<b>H</b>	<b>Cl</b>
<b>B-135</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>CN</b>	<b>H</b>	<b>Br</b>
<b>B-136</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>CN</b>	<b>H</b>	<b>Me</b>
<b>B-137</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>CN</b>	<b>H</b>	<b>Et</b>
<b>B-138</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>CN</b>	<b>H</b>	<b>iPr</b>

[0291]

<b>B-139</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>CN</b>	<b>H</b>	<b>cPr</b>
<b>B-140</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>CN</b>	<b>H</b>	<b>OMe</b>
<b>B-141</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>CN</b>	<b>H</b>	<b>OEt</b>
<b>B-142</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>CN</b>	<b>H</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>
<b>B-143</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>CN</b>	<b>H</b>	<b>OCF<sub>3</sub></b>
<b>B-144</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>H</b>	<b>F</b>
<b>B-145</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>H</b>	<b>Cl</b>
<b>B-146</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>H</b>	<b>Br</b>
<b>B-147</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>H</b>	<b>Me</b>
<b>B-148</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>H</b>	<b>Et</b>
<b>B-149</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>H</b>	<b>iPr</b>
<b>B-150</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>H</b>	<b>cPr</b>
<b>B-151</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>H</b>	<b>OMe</b>
<b>B-152</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>H</b>	<b>OEt</b>
<b>B-153</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>H</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>
<b>B-154</b>	<b>1</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>H</b>	<b>OCF<sub>3</sub></b>
<b>B-155</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Me</b>	<b>F</b>
<b>B-156</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Me</b>	<b>Cl</b>
<b>B-157</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Me</b>	<b>Br</b>
<b>B-158</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Me</b>	<b>Me</b>
<b>B-159</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Me</b>	<b>Et</b>
<b>B-160</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Me</b>	<b>iPr</b>
<b>B-161</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Me</b>	<b>cPr</b>
<b>B-162</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Me</b>	<b>OMe</b>
<b>B-163</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Me</b>	<b>OEt</b>
<b>B-164</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Me</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>
<b>B-165</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Me</b>	<b>OCF<sub>3</sub></b>
<b>B-166</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Et</b>	<b>F</b>
<b>B-167</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Et</b>	<b>Cl</b>
<b>B-168</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Et</b>	<b>Br</b>
<b>B-169</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Et</b>	<b>Me</b>
<b>B-170</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Et</b>	<b>Et</b>
<b>B-171</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Et</b>	<b>iPr</b>
<b>B-172</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Et</b>	<b>cPr</b>
<b>B-173</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Et</b>	<b>OMe</b>
<b>B-174</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Et</b>	<b>OEt</b>
<b>B-175</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Et</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>
<b>B-176</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>Et</b>	<b>OCF<sub>3</sub></b>
<b>B-177</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>CN</b>	<b>F</b>

[0292]

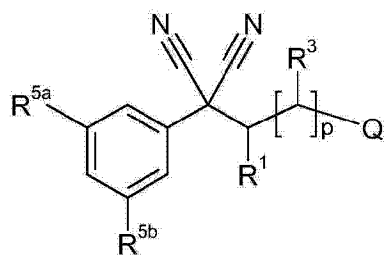
B-178	1	H	CN	Cl
B-179	1	H	CN	Br
B-180	1	H	CN	Me
B-181	1	H	CN	Et
B-182	1	H	CN	iPr
B-183	1	H	CN	cPr
B-184	1	H	CN	OMe
B-185	1	H	CN	OEt
B-186	1	H	CN	CF <sub>3</sub>
B-187	1	H	CN	OCF <sub>3</sub>
B-188	1	H	CF <sub>3</sub>	F
B-189	1	H	CF <sub>3</sub>	Cl
B-190	1	H	CF <sub>3</sub>	Br
B-191	1	H	CF <sub>3</sub>	Me
B-192	1	H	CF <sub>3</sub>	Et
B-193	1	H	CF <sub>3</sub>	iPr
B-194	1	H	CF <sub>3</sub>	cPr
B-195	1	H	CF <sub>3</sub>	OMe
B-196	1	H	CF <sub>3</sub>	OEt
B-197	1	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
B-198	1	H	CF <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>
B-199	1	H	CH <sub>2</sub> CN	F
B-200	1	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl
B-201	1	H	CH <sub>2</sub> CN	Br
B-202	1	H	CH <sub>2</sub> CN	Me
B-203	1	H	CH <sub>2</sub> CN	Et
B-204	1	H	CH <sub>2</sub> CN	iPr
B-205	1	H	CH <sub>2</sub> CN	cPr
B-206	1	H	CH <sub>2</sub> CN	OMe
B-207	1	H	CH <sub>2</sub> CN	OEt
B-208	1	H	CH <sub>2</sub> CN	CF <sub>3</sub>
B-209	1	H	CH <sub>2</sub> CN	OCF <sub>3</sub>
B-210	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	F
B-211	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	Cl
B-212	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	Br
B-213	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	Me
B-214	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	Et
B-215	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	iPr
B-216	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	cPr

[0293]

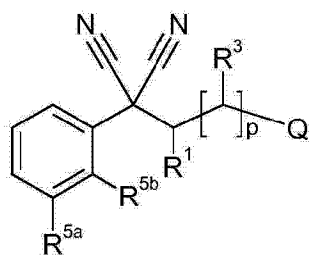
<b>B-217</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>OMe</b>
<b>B-218</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>OEt</b>
<b>B-219</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>
<b>B-220</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>OCF<sub>3</sub></b>

[0294] 进一步优选的式 (I) 化合物是式 (Ic-1)、(Ic-2)、(Ic-3)、(Ic-4)、(Ic-5)、(Ic-6)、(Ic-7)、(Ic-8) 或 (Ic-9) 化合物：

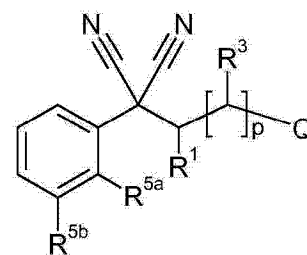
[0295]



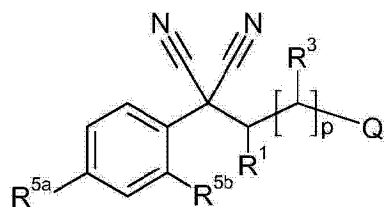
(Ic-1)



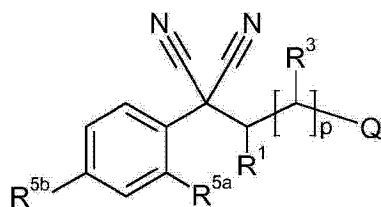
(Ic-2)



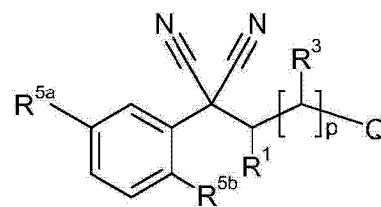
(Ic-3)



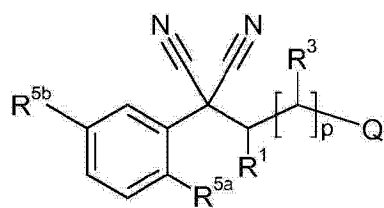
(Ic-4)



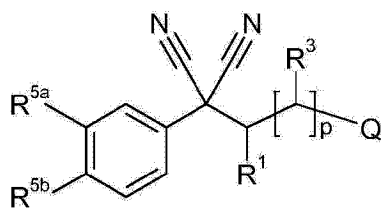
(Ic-5)



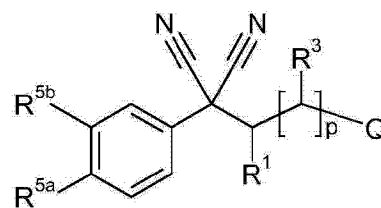
(Ic-6)



(Ic-7)



(Ic-8)



(Ic-9)

[0296] 其中 Y 为被 2 个取代基 R<sup>5</sup> 取代的苯基；一个 R<sup>5</sup> 为 R<sup>5a</sup> 且另一 R<sup>5</sup> 为 R<sup>5b</sup>；R<sup>2</sup> 为 H；R<sup>4</sup> 为 H；Q 如式 (I) 中所定义；并且 p、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>5a</sup> 和 R<sup>5b</sup> 如表 C 中所定义。

[0297] 表 C

[0298]

序号	p	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
<b>C-001</b>	<b>0</b>	<b>H</b>	—	<b>F</b>	<b>Cl</b>
<b>C-002</b>	<b>0</b>	<b>H</b>	—	<b>F</b>	<b>Me</b>
<b>C-003</b>	<b>0</b>	<b>H</b>	—	<b>Cl</b>	<b>Me</b>
<b>C-004</b>	<b>0</b>	<b>H</b>	—	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>
<b>C-005</b>	<b>0</b>	<b>H</b>	—	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>Cl</b>
<b>C-006</b>	<b>0</b>	<b>H</b>	—	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>Me</b>

[0299]

C-007	0	H	—	CN	F
C-008	0	H	—	CN	Cl
C-009	0	H	—	乙炔基	F
C-010	0	H	—	乙炔基	Cl
C-011	0	H	—	乙炔基	Me
C-012	0	H	—	乙炔基	CF <sub>3</sub>
C-013	0	H	—	OCF <sub>3</sub>	F
C-014	0	H	—	OCF <sub>3</sub>	Cl
C-015	0	H	—	OCF <sub>3</sub>	Me
C-016	0	H	—	OCF <sub>3</sub>	乙炔基
C-017	1	H	H	F	Cl
C-018	1	H	H	F	Me
C-019	1	H	H	Cl	Me
C-020	1	H	H	CF <sub>3</sub>	F
C-021	1	H	H	CF <sub>3</sub>	Cl
C-022	1	H	H	CF <sub>3</sub>	Me
C-023	1	H	H	CN	F
C-024	1	H	H	CN	Cl
C-025	1	H	H	乙炔基	F
C-026	1	H	H	乙炔基	Cl
C-027	1	H	H	乙炔基	Me
C-028	1	H	H	乙炔基	CF <sub>3</sub>
C-029	1	H	H	OCF <sub>3</sub>	F
C-030	1	H	H	OCF <sub>3</sub>	Cl
C-031	1	H	H	OCF <sub>3</sub>	Me
C-032	1	H	H	OCF <sub>3</sub>	乙炔基
C-033	0	Me	—	F	Cl
C-034	0	Me	—	F	Me
C-035	0	Me	—	Cl	Me
C-036	0	Me	—	CF <sub>3</sub>	F
C-037	0	Me	—	CF <sub>3</sub>	Cl
C-038	0	Me	—	CF <sub>3</sub>	Me
C-039	0	Me	—	CN	F
C-040	0	Me	—	CN	Cl
C-041	0	Me	—	乙炔基	F
C-042	0	Me	—	乙炔基	Cl
C-043	0	Me	—	乙炔基	Me
C-044	0	Me	—	乙炔基	CF <sub>3</sub>
C-045	0	Me	—	OCF <sub>3</sub>	F

[0300]

C-046	0	Me	—	OCF <sub>3</sub>	Cl
C-047	0	Me	—	OCF <sub>3</sub>	Me
C-048	0	Me	—	OCF <sub>3</sub>	乙炔基
C-049	0	Et	—	F	Cl
C-050	0	Et	—	F	Me
C-051	0	Et	—	Cl	Me
C-052	0	Et	—	CF <sub>3</sub>	F
C-053	0	Et	—	CF <sub>3</sub>	Cl
C-054	0	Et	—	CF <sub>3</sub>	Me
C-055	0	Et	—	CN	F
C-056	0	Et	—	CN	Cl
C-057	0	Et	—	CN	Me
C-058	0	Et	—	乙炔基	F
C-059	0	Et	—	乙炔基	Cl
C-060	0	Et	—	乙炔基	Me
C-061	0	Et	—	乙炔基	CF <sub>3</sub>
C-062	0	Et	—	OCF <sub>3</sub>	F
C-063	0	Et	—	OCF <sub>3</sub>	Cl
C-064	0	Et	—	OCF <sub>3</sub>	Me
C-065	0	Et	—	OCF <sub>3</sub>	乙炔基
C-066	0	CN	—	F	Cl
C-067	0	CN	—	F	Me
C-068	0	CN	—	Cl	Me
C-069	0	CN	—	CF <sub>3</sub>	F
C-070	0	CN	—	CF <sub>3</sub>	Cl
C-071	0	CN	—	CF <sub>3</sub>	Me
C-072	0	CN	—	CN	F
C-073	0	CN	—	CN	Cl
C-074	0	CN	—	乙炔基	F
C-075	0	CN	—	乙炔基	Cl
C-076	0	CN	—	乙炔基	Me
C-077	0	CN	—	乙炔基	CF <sub>3</sub>
C-078	0	CN	—	OCF <sub>3</sub>	F
C-079	0	CN	—	OCF <sub>3</sub>	Cl
C-080	0	CN	—	OCF <sub>3</sub>	Me
C-081	0	CN	—	OCF <sub>3</sub>	乙炔基
C-082	0	CF <sub>3</sub>	—	F	Cl
C-083	0	CF <sub>3</sub>	—	F	Me
C-084	0	CF <sub>3</sub>	—	Cl	Me

[0301]



C-085	0	CF <sub>3</sub>	—	CF <sub>3</sub>	F
C-086	0	CF <sub>3</sub>	—	CF <sub>3</sub>	Cl
C-087	0	CF <sub>3</sub>	—	CF <sub>3</sub>	Me
C-088	0	CF <sub>3</sub>	—	CN	F
C-089	0	CF <sub>3</sub>	—	CN	Cl
C-090	0	CF <sub>3</sub>	—	乙炔基	F
C-091	0	CF <sub>3</sub>	—	乙炔基	Cl
C-092	0	CF <sub>3</sub>	—	乙炔基	Me
C-093	0	CF <sub>3</sub>	—	乙炔基	CF <sub>3</sub>
C-094	0	CF <sub>3</sub>	—	OCF <sub>3</sub>	F
C-095	0	CF <sub>3</sub>	—	OCF <sub>3</sub>	Cl
C-096	0	CF <sub>3</sub>	—	OCF <sub>3</sub>	Me
C-097	0	CF <sub>3</sub>	—	OCF <sub>3</sub>	乙炔基
C-098	0	CH <sub>2</sub> CN	—	F	Cl
C-099	0	CH <sub>2</sub> CN	—	F	Me
C-100	0	CH <sub>2</sub> CN	—	Cl	Me
C-101	0	CH <sub>2</sub> CN	—	CF <sub>3</sub>	F
C-102	0	CH <sub>2</sub> CN	—	CF <sub>3</sub>	Cl
C-103	0	CH <sub>2</sub> CN	—	CF <sub>3</sub>	Me
C-104	0	CH <sub>2</sub> CN	—	CN	F
C-105	0	CH <sub>2</sub> CN	—	CN	Cl
C-106	0	CH <sub>2</sub> CN	—	乙炔基	F
C-107	0	CH <sub>2</sub> CN	—	乙炔基	Cl
C-108	0	CH <sub>2</sub> CN	—	乙炔基	Me
C-109	0	CH <sub>2</sub> CN	—	乙炔基	CF <sub>3</sub>
C-110	0	CH <sub>2</sub> CN	—	OCF <sub>3</sub>	F
C-111	0	CH <sub>2</sub> CN	—	OCF <sub>3</sub>	Cl
C-112	0	CH <sub>2</sub> CN	—	OCF <sub>3</sub>	Me
C-113	0	CH <sub>2</sub> CN	—	OCF <sub>3</sub>	乙炔基
C-114	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	F	Cl
C-115	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	F	Me
C-116	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	Cl	Me
C-117	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	CF <sub>3</sub>	F
C-118	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	CF <sub>3</sub>	Cl
C-119	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	CF <sub>3</sub>	Me
C-120	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	CN	F
C-121	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	CN	Cl
C-122	0	CH <sub>2</sub> OMe	—	乙炔基	F

[0302]

C-123	0	CH <sub>2</sub> OMe		乙炔基	Cl
C-124	0	CH <sub>2</sub> OMe		乙炔基	Me
C-125	0	CH <sub>2</sub> OMe		乙炔基	CF <sub>3</sub>
C-126	0	CH <sub>2</sub> OMe		OCF <sub>3</sub>	F
C-127	0	CH <sub>2</sub> OMe		OCF <sub>3</sub>	Cl
C-128	0	CH <sub>2</sub> OMe		OCF <sub>3</sub>	Me
C-129	0	CH <sub>2</sub> OMe		OCF <sub>3</sub>	乙炔基
C-130	1	Me	H	F	Cl
C-131	1	Me	H	F	Me
C-132	1	Me	H	Cl	Me
C-133	1	Me	H	CF <sub>3</sub>	F
C-134	1	Me	H	CF <sub>3</sub>	Cl
C-135	1	Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
C-136	1	Me	H	CN	F
C-137	1	Me	H	CN	Cl
C-138	1	Me	H	乙炔基	F
C-139	1	Me	H	乙炔基	Cl
C-140	1	Me	H	乙炔基	Me
C-141	1	Me	H	乙炔基	CF <sub>3</sub>
C-142	1	Me	H	OCF <sub>3</sub>	F
C-143	1	Me	H	OCF <sub>3</sub>	Cl
C-144	1	Me	H	OCF <sub>3</sub>	Me
C-145	1	Me	H	OCF <sub>3</sub>	乙炔基
C-146	1	Et	H	F	Cl
C-147	1	Et	H	F	Me
C-148	1	Et	H	Cl	Me
C-149	1	Et	H	CF <sub>3</sub>	F
C-150	1	Et	H	CF <sub>3</sub>	Cl
C-151	1	Et	H	CF <sub>3</sub>	Me
C-152	1	Et	H	CN	F
C-153	1	Et	H	CN	Cl
C-154	1	Et	H	乙炔基	F
C-155	1	Et	H	乙炔基	Cl
C-156	1	Et	H	乙炔基	Me
C-157	1	Et	H	乙炔基	CF <sub>3</sub>
C-158	1	Et	H	OCF <sub>3</sub>	F
C-159	1	Et	H	OCF <sub>3</sub>	Cl
C-160	1	Et	H	OCF <sub>3</sub>	Me
C-161	1	Et	H	OCF <sub>3</sub>	乙炔基

[0303]

C-162	1	CN	H	F	Cl
C-163	1	CN	H	F	Me
C-164	1	CN	H	Cl	Me
C-165	1	CN	H	CF <sub>3</sub>	F
C-166	1	CN	H	CF <sub>3</sub>	Cl
C-167	1	CN	H	CF <sub>3</sub>	Me
C-168	1	CN	H	CN	F
C-169	1	CN	H	CN	Cl
C-170	1	CN	H	乙炔基	F
C-171	1	CN	H	乙炔基	Cl
C-172	1	CN	H	乙炔基	Me
C-173	1	CN	H	乙炔基	CF <sub>3</sub>
C-174	1	CN	H	OCF <sub>3</sub>	F
C-175	1	CN	H	OCF <sub>3</sub>	Cl
C-176	1	CN	H	OCF <sub>3</sub>	Me
C-177	1	CN	H	OCF <sub>3</sub>	乙炔基
C-178	1	CF <sub>3</sub>	H	F	Cl
C-179	1	CF <sub>3</sub>	H	F	Me
C-180	1	CF <sub>3</sub>	H	Cl	Me
C-181	1	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	F
C-182	1	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	Cl
C-183	1	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	Me
C-184	1	CF <sub>3</sub>	H	CN	F
C-185	1	CF <sub>3</sub>	H	CN	Cl
C-186	1	CF <sub>3</sub>	H	乙炔基	F
C-187	1	CF <sub>3</sub>	H	乙炔基	Cl
C-188	1	CF <sub>3</sub>	H	乙炔基	Me
C-189	1	CF <sub>3</sub>	H	乙炔基	CF <sub>3</sub>
C-190	1	CF <sub>3</sub>	H	OCF <sub>3</sub>	F
C-191	1	CF <sub>3</sub>	H	OCF <sub>3</sub>	Cl
C-192	1	CF <sub>3</sub>	H	OCF <sub>3</sub>	Me
C-193	1	CF <sub>3</sub>	H	OCF <sub>3</sub>	乙炔基
C-194	1	CH <sub>2</sub> CN	H	F	Cl
C-195	1	CH <sub>2</sub> CN	H	F	Me
C-196	1	CH <sub>2</sub> CN	H	Cl	Me
C-197	1	CH <sub>2</sub> CN	H	CF <sub>3</sub>	F
C-198	1	CH <sub>2</sub> CN	H	CF <sub>3</sub>	Cl
C-199	1	CH <sub>2</sub> CN	H	CF <sub>3</sub>	Me

[0304]

C-200	1	CH <sub>2</sub> CN	H	CN	F
C-201	1	CH <sub>2</sub> CN	H	CN	Cl
C-202	1	CH <sub>2</sub> CN	H	乙炔基	F
C-203	1	CH <sub>2</sub> CN	H	乙炔基	Cl
C-204	1	CH <sub>2</sub> CN	H	乙炔基	Me
C-205	1	CH <sub>2</sub> CN	H	乙炔基	CF <sub>3</sub>
C-206	1	CH <sub>2</sub> CN	H	OCF <sub>3</sub>	F
C-207	1	CH <sub>2</sub> CN	H	OCF <sub>3</sub>	Cl
C-208	1	CH <sub>2</sub> CN	H	OCF <sub>3</sub>	Me
C-209	1	CH <sub>2</sub> CN	H	OCF <sub>3</sub>	乙炔基
C-210	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	F	Cl
C-211	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	F	Me
C-212	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	Cl	Me
C-213	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	CF <sub>3</sub>	F
C-214	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	CF <sub>3</sub>	Cl
C-215	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	CF <sub>3</sub>	Me
C-216	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	CN	F
C-217	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	CN	Cl
C-218	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	乙炔基	F
C-219	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	乙炔基	Cl
C-220	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	乙炔基	Me
C-221	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	乙炔基	CF <sub>3</sub>
C-222	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	OCF <sub>3</sub>	F
C-223	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	OCF <sub>3</sub>	Cl
C-224	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	OCF <sub>3</sub>	Me
C-225	1	CH <sub>2</sub> OMe	H	OCF <sub>3</sub>	乙炔基
C-226	1	H	Me	F	Cl
C-227	1	H	Me	F	Me
C-228	1	H	Me	Cl	Me
C-229	1	H	Me	CF <sub>3</sub>	F
C-230	1	H	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
C-231	1	H	Me	CF <sub>3</sub>	Me
C-232	1	H	Me	CN	F
C-233	1	H	Me	CN	Cl
C-234	1	H	Me	乙炔基	F
C-235	1	H	Me	乙炔基	Cl
C-236	1	H	Me	乙炔基	Me
C-237	1	H	Me	乙炔基	CF <sub>3</sub>

[0305]

C-238	1	H	Me	OCF <sub>3</sub>	F
C-239	1	H	Me	OCF <sub>3</sub>	Cl
C-240	1	H	Me	OCF <sub>3</sub>	Me
C-241	1	H	Me	OCF <sub>3</sub>	乙炔基
C-242	1	H	Et	F	Cl
C-243	1	H	Et	F	Me
C-244	1	H	Et	Cl	Me
C-245	1	H	Et	CF <sub>3</sub>	F
C-246	1	H	Et	CF <sub>3</sub>	Cl
C-247	1	H	Et	CF <sub>3</sub>	Me
C-248	1	H	Et	CN	F
C-249	1	H	Et	CN	Cl
C-250	1	H	Et	乙炔基	F
C-251	1	H	Et	乙炔基	Cl
C-252	1	H	Et	乙炔基	Me
C-253	1	H	Et	乙炔基	CF <sub>3</sub>
C-254	1	H	Et	OCF <sub>3</sub>	F
C-255	1	H	Et	OCF <sub>3</sub>	Cl
C-256	1	H	Et	OCF <sub>3</sub>	Me
C-257	1	H	Et	OCF <sub>3</sub>	乙炔基
C-258	1	H	CN	F	Cl
C-259	1	H	CN	F	Me
C-260	1	H	CN	Cl	Me
C-261	1	H	CN	CF <sub>3</sub>	F
C-262	1	H	CN	CF <sub>3</sub>	Cl
C-263	1	H	CN	CF <sub>3</sub>	Me
C-264	1	H	CN	CN	F
C-265	1	H	CN	CN	Cl
C-266	1	H	CN	乙炔基	F
C-267	1	H	CN	乙炔基	Cl
C-268	1	H	CN	乙炔基	Me
C-269	1	H	CN	乙炔基	CF <sub>3</sub>
C-270	1	H	CN	OCF <sub>3</sub>	F
C-271	1	H	CN	OCF <sub>3</sub>	Cl
C-272	1	H	CN	OCF <sub>3</sub>	Me
C-273	1	H	CN	OCF <sub>3</sub>	乙炔基
C-274	1	H	CF <sub>3</sub>	F	Cl
C-275	1	H	CF <sub>3</sub>	F	Me
C-276	1	H	CF <sub>3</sub>	Cl	Me

[0306]

C-277	1	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F
C-278	1	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
C-279	1	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
C-280	1	H	CF <sub>3</sub>	CN	F
C-281	1	H	CF <sub>3</sub>	CN	Cl
C-282	1	H	CF <sub>3</sub>	乙炔基	F
C-283	1	H	CF <sub>3</sub>	乙炔基	Cl
C-284	1	H	CF <sub>3</sub>	乙炔基	Me
C-285	1	H	CF <sub>3</sub>	乙炔基	CF <sub>3</sub>
C-286	1	H	CF <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	F
C-287	1	H	CF <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	Cl
C-288	1	H	CF <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	Me
C-289	1	H	CF <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	乙炔基
C-290	1	H	CH <sub>2</sub> CN	F	Cl
C-291	1	H	CH <sub>2</sub> CN	F	Me
C-292	1	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl	Me
C-293	1	H	CH <sub>2</sub> CN	CF <sub>3</sub>	F
C-294	1	H	CH <sub>2</sub> CN	CF <sub>3</sub>	Cl
C-295	1	H	CH <sub>2</sub> CN	CF <sub>3</sub>	Me
C-296	1	H	CH <sub>2</sub> CN	CN	F
C-297	1	H	CH <sub>2</sub> CN	CN	Cl
C-298	1	H	CH <sub>2</sub> CN	乙炔基	F
C-299	1	H	CH <sub>2</sub> CN	乙炔基	Cl
C-300	1	H	CH <sub>2</sub> CN	乙炔基	Me
C-301	1	H	CH <sub>2</sub> CN	乙炔基	CF <sub>3</sub>
C-302	1	H	CH <sub>2</sub> CN	OCF <sub>3</sub>	F
C-303	1	H	CH <sub>2</sub> CN	OCF <sub>3</sub>	Cl
C-304	1	H	CH <sub>2</sub> CN	OCF <sub>3</sub>	Me
C-305	1	H	CH <sub>2</sub> CN	OCF <sub>3</sub>	乙炔基
C-306	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	F	Cl
C-307	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	F	Me
C-308	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	Cl	Me
C-309	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	F
C-310	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	Cl
C-311	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	CF <sub>3</sub>	Me
C-312	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	CN	F
C-313	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	CN	Cl
C-314	1	H	CH <sub>2</sub> OMe	乙炔基	F

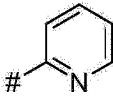
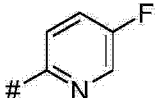
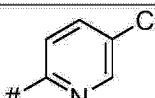
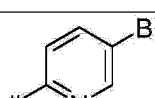
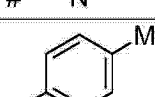
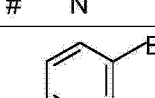
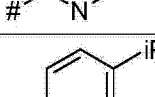
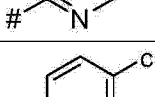
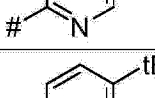
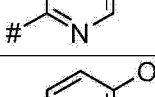
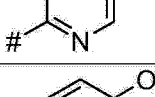
[0307]

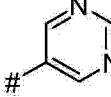
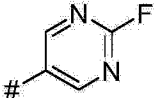
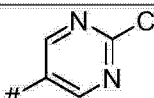
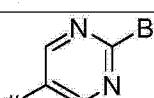
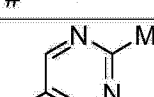
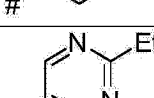
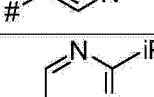
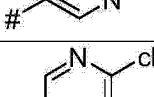
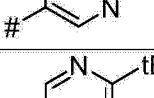
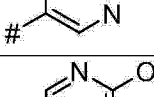
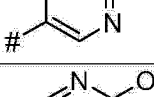
<b>C-315</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>乙炔基</b>	<b>Cl</b>
<b>C-316</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>乙炔基</b>	<b>Me</b>
<b>C-317</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>乙炔基</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>
<b>C-318</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>OCF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>
<b>C-319</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>OCF<sub>3</sub></b>	<b>Cl</b>
<b>C-320</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>OCF<sub>3</sub></b>	<b>Me</b>
<b>C-321</b>	<b>1</b>	<b>H</b>	<b>CH<sub>2</sub>OMe</b>	<b>OCF<sub>3</sub></b>	<b>乙炔基</b>

[0308] Q 的进一步优选含义给予表 D 中。

[0309] 表 D

[0310]

序号	Q
<b>D-001</b>	
<b>D-002</b>	
<b>D-003</b>	
<b>D-004</b>	
<b>D-005</b>	
<b>D-006</b>	
<b>D-007</b>	
<b>D-008</b>	
<b>D-009</b>	
<b>D-010</b>	
<b>D-011</b>	

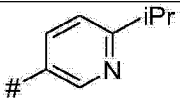
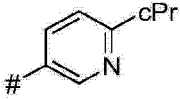
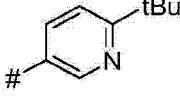
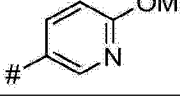
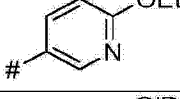
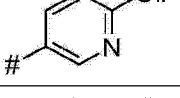
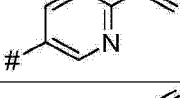
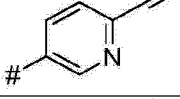
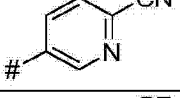
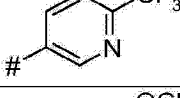
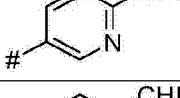
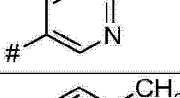
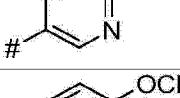
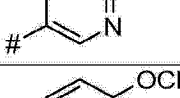
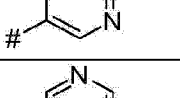
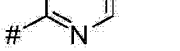
序号	Q
<b>D-064</b>	
<b>D-065</b>	
<b>D-066</b>	
<b>D-067</b>	
<b>D-068</b>	
<b>D-069</b>	
<b>D-070</b>	
<b>D-071</b>	
<b>D-072</b>	
<b>D-073</b>	
<b>D-074</b>	

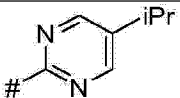
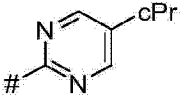
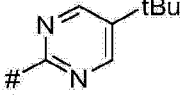
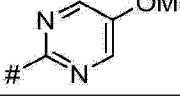
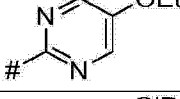
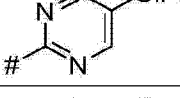
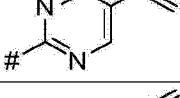
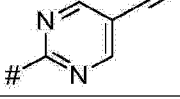
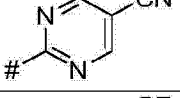
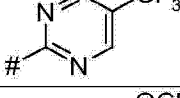
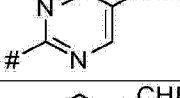
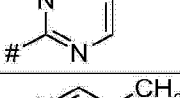
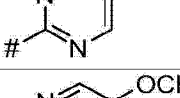
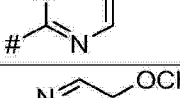
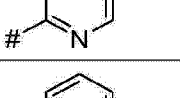
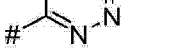
[0311]

<b>D-012</b>		<b>D-075</b>	
<b>D-013</b>		<b>D-076</b>	
<b>D-014</b>		<b>D-077</b>	
<b>D-015</b>		<b>D-078</b>	
<b>D-016</b>		<b>D-079</b>	
<b>D-017</b>		<b>D-080</b>	
<b>D-018</b>		<b>D-081</b>	
<b>D-019</b>		<b>D-082</b>	
<b>D-020</b>		<b>D-083</b>	
<b>D-021</b>		<b>D-084</b>	
<b>D-022</b>		<b>D-085</b>	
<b>D-023</b>		<b>D-086</b>	
<b>D-024</b>		<b>D-087</b>	
<b>D-025</b>		<b>D-088</b>	
<b>D-026</b>		<b>D-089</b>	
<b>D-027</b>		<b>D-090</b>	

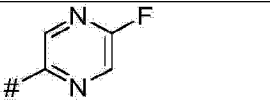
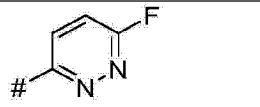
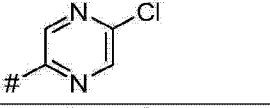
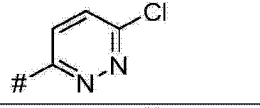
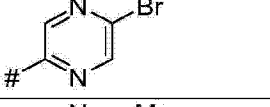
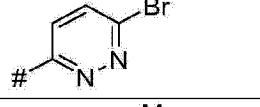
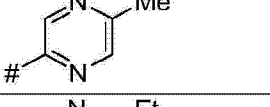
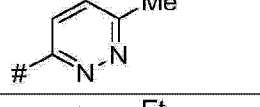
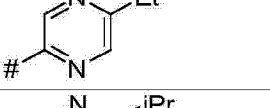
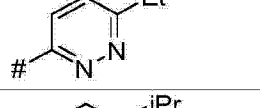
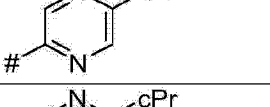
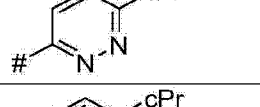
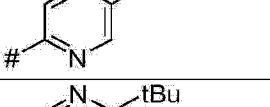
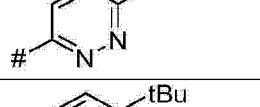
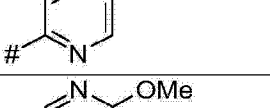
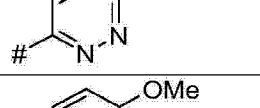
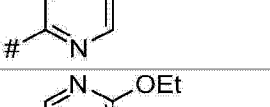
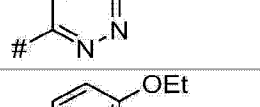
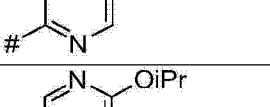
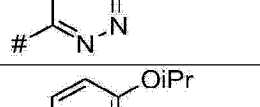
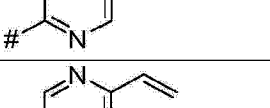
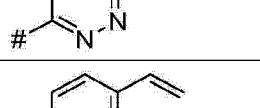
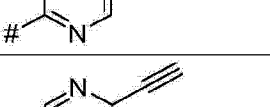
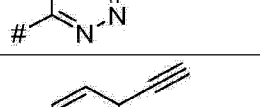
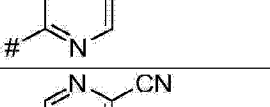
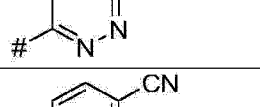
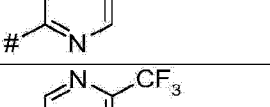
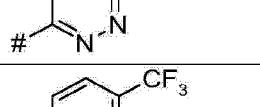
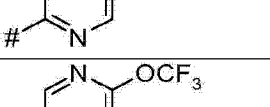
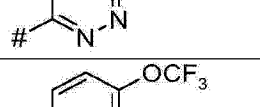
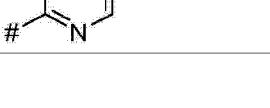
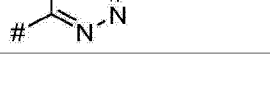
[0312]



<b>D-028</b>	
<b>D-029</b>	
<b>D-030</b>	
<b>D-031</b>	
<b>D-032</b>	
<b>D-033</b>	
<b>D-034</b>	
<b>D-035</b>	
<b>D-036</b>	
<b>D-037</b>	
<b>D-038</b>	
<b>D-039</b>	
<b>D-040</b>	
<b>D-041</b>	
<b>D-042</b>	
<b>D-043</b>	

<b>D-091</b>	
<b>D-092</b>	
<b>D-093</b>	
<b>D-094</b>	
<b>D-095</b>	
<b>D-096</b>	
<b>D-097</b>	
<b>D-098</b>	
<b>D-099</b>	
<b>D-100</b>	
<b>D-101</b>	
<b>D-102</b>	
<b>D-103</b>	
<b>D-104</b>	
<b>D-105</b>	
<b>D-106</b>	

[0313]

<b>D-044</b>		<b>D-107</b>	
<b>D-045</b>		<b>D-108</b>	
<b>D-046</b>		<b>D-109</b>	
<b>D-047</b>		<b>D-110</b>	
<b>D-048</b>		<b>D-111</b>	
<b>D-049</b>		<b>D-112</b>	
<b>D-050</b>		<b>D-113</b>	
<b>D-051</b>		<b>D-114</b>	
<b>D-052</b>		<b>D-115</b>	
<b>D-053</b>		<b>D-116</b>	
<b>D-054</b>		<b>D-117</b>	
<b>D-055</b>		<b>D-118</b>	
<b>D-056</b>		<b>D-119</b>	
<b>D-057</b>		<b>D-120</b>	
<b>D-058</b>		<b>D-121</b>	
<b>D-059</b>		<b>D-122</b>	

[0314]

<b>D-060</b>		<b>D-123</b>	
<b>D-061</b>		<b>D-124</b>	
<b>D-062</b>		<b>D-125</b>	
<b>D-063</b>		<b>D-126</b>	

[0315] 表 1d : 式 (Ia-1)、(Ia-2) 和 (Ia-3) 化合物, 其中 Q 如表 D 的 D-001 项所定义且 p、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup> 和 R<sup>5</sup> 在每种情况下对应于表 A 的一行 ; 式 (Ib-1)、(Ib-2)、(Ib-3)、(Ib-4)、(Ib-5)、(Ib-6)、(Ib-7)、(Ib-8)、(Ib-9)、(Ib-10)、(Ib-11) 和 (Ib-12) 化合物, 其中 Q 如表 D 的 D-001 项所定义且 p、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup> 和 R<sup>5</sup> 在每种情况下对应于表 B 的一行 ; 以及式 (Ic-1)、(Ic-2)、(Ic-3)、(Ic-4)、(Ic-5)、(Ic-6)、(Ic-7)、(Ic-8) 和 (Ic-9) 化合物, 其中 Q 如表 D 的 D-001 项所定义且 p、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>5a</sup> 和 R<sup>5b</sup> 在每种情况下对应于表 C 的一行。

[0316] 表 2d : 式 (Ia-1)、(Ia-2) 和 (Ia-3) 化合物, 其中 Q 如表 D 的 D-002 项所定义且 p、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup> 和 R<sup>5</sup> 在每种情况下对应于表 A 的一行 ; 式 (Ib-1)、(Ib-2)、(Ib-3)、(Ib-4)、(Ib-5)、(Ib-6)、(Ib-7)、(Ib-8)、(Ib-9)、(Ib-10)、(Ib-11) 和 (Ib-12) 化合物, 其中 Q 如表 D 的 D-002 项所定义且 p、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup> 和 R<sup>5</sup> 在每种情况下对应于表 B 的一行 ; 以及式 (Ic-1)、(Ic-2)、(Ic-3)、(Ic-4)、(Ic-5)、(Ic-6)、(Ic-7)、(Ic-8) 和 (Ic-9) 化合物, 其中 Q 如表 D 的 D-002 项所定义且 p、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>5a</sup> 和 R<sup>5b</sup> 在每种情况下对应于表 C 的一行。

[0317] 表 3d : 式 (Ia-1)、(Ia-2) 和 (Ia-3) 化合物, 其中 Q 如表 D 的 D-003 项所定义且 p、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup> 和 R<sup>5</sup> 在每种情况下对应于表 A 的一行 ; 式 (Ib-1)、(Ib-2)、(Ib-3)、(Ib-4)、(Ib-5)、(Ib-6)、(Ib-7)、(Ib-8)、(Ib-9)、(Ib-10)、(Ib-11) 和 (Ib-12) 化合物, 其中 Q 如表 D 的 D-003 项所定义且 p、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup> 和 R<sup>5</sup> 在每种情况下对应于表 B 的一行 ; 以及式 (Ic-1)、(Ic-2)、(Ic-3)、(Ic-4)、(Ic-5)、(Ic-6)、(Ic-7)、(Ic-8) 和 (Ic-9) 化合物, 其中 Q 如表 D 的 D-003 项所定义且 p、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>5a</sup> 和 R<sup>5b</sup> 在每种情况下对应于表 C 的一行。

[0318] 表 4d : 式 (Ia-1)、(Ia-2) 和 (Ia-3) 化合物, 其中 Q 如表 D 的 D-004 项所定义且 p、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup> 和 R<sup>5</sup> 在每种情况下对应于表 A 的一行 ; 式 (Ib-1)、(Ib-2)、(Ib-3)、(Ib-4)、(Ib-5)、(Ib-6)、(Ib-7)、(Ib-8)、(Ib-9)、(Ib-10)、(Ib-11) 和 (Ib-12) 化合物, 其中 Q 如表 D 的 D-004 项所定义且 p、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup> 和 R<sup>5</sup> 在每种情况下对应于表 B 的一行 ; 以及式 (Ic-1)、(Ic-2)、(Ic-3)、(Ic-4)、(Ic-5)、(Ic-6)、(Ic-7)、(Ic-8) 和 (Ic-9) 化合物, 其中 Q 如表 D 的 D-004 项所定义且 p、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>5a</sup> 和 R<sup>5b</sup> 在每种情况下对应于表 C 的一行。

[0319] 表 5d : 式 (Ia-1)、(Ia-2) 和 (Ia-3) 化合物, 其中 Q 如表 D 的 D-005 项所定义且 p、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup> 和 R<sup>5</sup> 在每种情况下对应于表 A 的一行 ; 式 (Ib-1)、(Ib-2)、(Ib-3)、(Ib-4)、(Ib-5)、(Ib-6)、(Ib-7)、(Ib-8)、(Ib-9)、(Ib-10)、(Ib-11) 和 (Ib-12) 化合物, 其中 Q 如表 D 的 D-005 项所定义且 p、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup> 和 R<sup>5</sup> 在每种情况下对应于表 B 的一行 ; 以及式 (Ic-1)、(Ic-2)、(Ic-3)、(Ic-4)、(Ic-5)、(Ic-6)、(Ic-7)、(Ic-8) 和 (Ic-9) 化合物, 其中 Q 如表 D 的 D-005

































项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和  $R^{5b}$ 在每种情况下对应于表 C 的一行。

[0411] 表 96d :式 (Ia-1)、(Ia-2) 和 (Ia-3) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-96 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 A 的一行 ;式 (Ib-1)、(Ib-2)、(Ib-3)、(Ib-4)、(Ib-5)、(Ib-6)、(Ib-7)、(Ib-8)、(Ib-9)、(Ib-10)、(Ib-11) 和 (Ib-12) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-96 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 B 的一行 ;以及式 (Ic-1)、(Ic-2)、(Ic-3)、(Ic-4)、(Ic-5)、(Ic-6)、(Ic-7)、(Ic-8) 和 (Ic-9) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-96 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和  $R^{5b}$ 在每种情况下对应于表 C 的一行。

[0412] 表 97d :式 (Ia-1)、(Ia-2) 和 (Ia-3) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-97 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 A 的一行 ;式 (Ib-1)、(Ib-2)、(Ib-3)、(Ib-4)、(Ib-5)、(Ib-6)、(Ib-7)、(Ib-8)、(Ib-9)、(Ib-10)、(Ib-11) 和 (Ib-12) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-97 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 B 的一行 ;以及式 (Ic-1)、(Ic-2)、(Ic-3)、(Ic-4)、(Ic-5)、(Ic-6)、(Ic-7)、(Ic-8) 和 (Ic-9) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-97 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和  $R^{5b}$ 在每种情况下对应于表 C 的一行。

[0413] 表 98d :式 (Ia-1)、(Ia-2) 和 (Ia-3) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-98 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 A 的一行 ;式 (Ib-1)、(Ib-2)、(Ib-3)、(Ib-4)、(Ib-5)、(Ib-6)、(Ib-7)、(Ib-8)、(Ib-9)、(Ib-10)、(Ib-11) 和 (Ib-12) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-98 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 B 的一行 ;以及式 (Ic-1)、(Ic-2)、(Ic-3)、(Ic-4)、(Ic-5)、(Ic-6)、(Ic-7)、(Ic-8) 和 (Ic-9) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-98 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和  $R^{5b}$ 在每种情况下对应于表 C 的一行。

[0414] 表 99d :式 (Ia-1)、(Ia-2) 和 (Ia-3) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-99 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 A 的一行 ;式 (Ib-1)、(Ib-2)、(Ib-3)、(Ib-4)、(Ib-5)、(Ib-6)、(Ib-7)、(Ib-8)、(Ib-9)、(Ib-10)、(Ib-11) 和 (Ib-12) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-99 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 B 的一行 ;以及式 (Ic-1)、(Ic-2)、(Ic-3)、(Ic-4)、(Ic-5)、(Ic-6)、(Ic-7)、(Ic-8) 和 (Ic-9) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-99 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和  $R^{5b}$ 在每种情况下对应于表 C 的一行。

[0415] 表 100d :式 (Ia-1)、(Ia-2) 和 (Ia-3) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-100 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 A 的一行 ;式 (Ib-1)、(Ib-2)、(Ib-3)、(Ib-4)、(Ib-5)、(Ib-6)、(Ib-7)、(Ib-8)、(Ib-9)、(Ib-10)、(Ib-11) 和 (Ib-12) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-100 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 B 的一行 ;以及式 (Ic-1)、(Ic-2)、(Ic-3)、(Ic-4)、(Ic-5)、(Ic-6)、(Ic-7)、(Ic-8) 和 (Ic-9) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-100 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和  $R^{5b}$ 在每种情况下对应于表 C 的一行。

[0416] 表 101d :式 (Ia-1)、(Ia-2) 和 (Ia-3) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-101 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 A 的一行 ;式 (Ib-1)、(Ib-2)、(Ib-3)、(Ib-4)、(Ib-5)、(Ib-6)、(Ib-7)、(Ib-8)、(Ib-9)、(Ib-10)、(Ib-11) 和 (Ib-12) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-101 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 B 的一行 ;以及式 (Ic-1)、(Ic-2)、(Ic-3)、(Ic-4)、(Ic-5)、(Ic-6)、(Ic-7)、(Ic-8) 和 (Ic-9) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-101 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和  $R^{5b}$ 在每种情况下对应于表 C 的一行。

[0417] 表 102d :式 (Ia-1)、(Ia-2) 和 (Ia-3) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-102 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 A 的一行 ;式 (Ib-1)、(Ib-2)、(Ib-3)、(Ib-4)、(Ib-5)、







项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和  $R^{5b}$ 在每种情况下对应于表 C 的一行。

[0437] 表 122d :式 (Ia-1)、(Ia-2) 和 (Ia-3) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-122 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 A 的一行 ;式 (Ib-1)、(Ib-2)、(Ib-3)、(Ib-4)、(Ib-5)、(Ib-6)、(Ib-7)、(Ib-8)、(Ib-9)、(Ib-10)、(Ib-11) 和 (Ib-12) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-122 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 B 的一行 ;以及式 (Ic-1)、(Ic-2)、(Ic-3)、(Ic-4)、(Ic-5)、(Ic-6)、(Ic-7)、(Ic-8) 和 (Ic-9) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-122 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和  $R^{5b}$ 在每种情况下对应于表 C 的一行。

[0438] 表 123d :式 (Ia-1)、(Ia-2) 和 (Ia-3) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-123 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 A 的一行 ;式 (Ib-1)、(Ib-2)、(Ib-3)、(Ib-4)、(Ib-5)、(Ib-6)、(Ib-7)、(Ib-8)、(Ib-9)、(Ib-10)、(Ib-11) 和 (Ib-12) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-123 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 B 的一行 ;以及式 (Ic-1)、(Ic-2)、(Ic-3)、(Ic-4)、(Ic-5)、(Ic-6)、(Ic-7)、(Ic-8) 和 (Ic-9) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-123 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和  $R^{5b}$ 在每种情况下对应于表 C 的一行。

[0439] 表 124d :式 (Ia-1)、(Ia-2) 和 (Ia-3) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-124 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 A 的一行 ;式 (Ib-1)、(Ib-2)、(Ib-3)、(Ib-4)、(Ib-5)、(Ib-6)、(Ib-7)、(Ib-8)、(Ib-9)、(Ib-10)、(Ib-11) 和 (Ib-12) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-124 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 B 的一行 ;以及式 (Ic-1)、(Ic-2)、(Ic-3)、(Ic-4)、(Ic-5)、(Ic-6)、(Ic-7)、(Ic-8) 和 (Ic-9) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-124 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和  $R^{5b}$ 在每种情况下对应于表 C 的一行。

[0440] 表 125d :式 (Ia-1)、(Ia-2) 和 (Ia-3) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-125 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 A 的一行 ;式 (Ib-1)、(Ib-2)、(Ib-3)、(Ib-4)、(Ib-5)、(Ib-6)、(Ib-7)、(Ib-8)、(Ib-9)、(Ib-10)、(Ib-11) 和 (Ib-12) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-125 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 B 的一行 ;以及式 (Ic-1)、(Ic-2)、(Ic-3)、(Ic-4)、(Ic-5)、(Ic-6)、(Ic-7)、(Ic-8) 和 (Ic-9) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-125 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和  $R^{5b}$ 在每种情况下对应于表 C 的一行。

[0441] 表 126d :式 (Ia-1)、(Ia-2) 和 (Ia-3) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-126 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 A 的一行 ;式 (Ib-1)、(Ib-2)、(Ib-3)、(Ib-4)、(Ib-5)、(Ib-6)、(Ib-7)、(Ib-8)、(Ib-9)、(Ib-10)、(Ib-11) 和 (Ib-12) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-126 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 和  $R^5$ 在每种情况下对应于表 B 的一行 ;以及式 (Ic-1)、(Ic-2)、(Ic-3)、(Ic-4)、(Ic-5)、(Ic-6)、(Ic-7)、(Ic-8) 和 (Ic-9) 化合物,其中 Q 如表 D 的 D-126 项所定义且  $p$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和  $R^{5b}$ 在每种情况下对应于表 C 的一行。

[0442] 制备方法

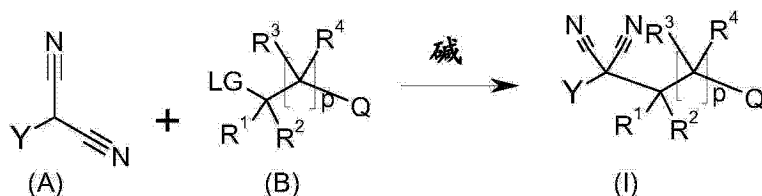
[0443] 本发明式 (I) 化合物可以例如根据下文所述制备方法和制备方案制备。

[0444] 在下列方案和方法中,若没有相反说明,则所用式中取代基、变量和指数的定义对应于上面对式 (I) 所给定义。

[0445] 式 (I) 化合物可以如下面的方案 A 所示制备。

[0446] 方案 A.

[0447]



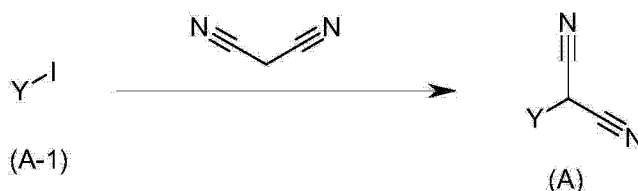
LG=离去基团

[0448] 使式 (A) 化合物与式 (B) 化合物在合适碱存在下反应而得到式 (I) 化合物。代表性程序已经描述于例如 M. M. Meyers, J. Sun, K. E. Carlson, G. A. Marriner, B. S. Katzenellenbogen, J. A. Katzenellenbogen, J. Med. Chem. 2001, 44, 4230-4251 中。

[0449] 式 (A) 化合物可以如各种出版物所述通过用丙二腈处理相应碘化合物 (A-1) 而制备 (方案 B)。例如,这可以在碱和合适催化剂体系存在下例如如 J. M. Atkins, S. A. Moteki, S. G. DiMugno, J. M. Takacs, Org. Lett. 2006, 13, 2759-2762 所述实现。或者,该反应也可以例如如 M. Makosza, A. Chesnokov, Tetrahedron 2008, 64, 5925-5932 所述在碱存在下经由铜催化进行。

[0450] 方案 B.

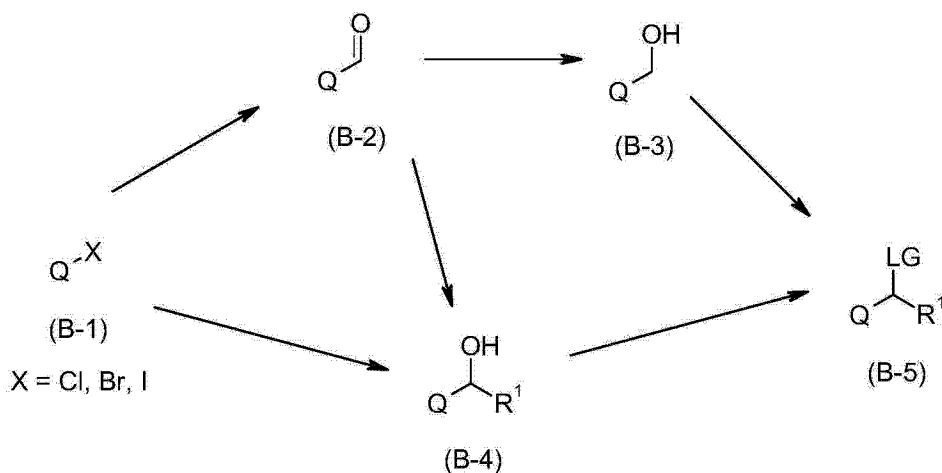
[0451]



[0452] 要求离去基团“LG”如卤素或甲磺酸酯的其中  $p = 0$  的式 (B) 化合物如方案 C 中的 (B-5) 可以如下所示由相应卤代化合物 (B-1) 开始得到。

[0453] 方案 C.

[0454]



[0455] 因此,例如如 WO 2012/058116 所述使式 (B-1) 化合物与锂碱反应并随后加入 DMF 得到式 (B-2) 化合物,后者例如如 WO 2012/022681 所述在用例如氢化物试剂如硼氢化钠还原之后得到 (B-3)。

[0456] 或者,还可以例如如 Y. Zhang, J. P. Burgess, M. Brackeen, A. Gilliam, S. W. Mascarella, K. Page, H. H. Seltzman, B. F. Thomas, J. Med. Chem. 2008, 51, 3526-3539 所

述在与锂碱反应之后用醛类如乙醛处理式 (B-1) 化合物, 直接得到式 (B-4) 化合物。此外, 可以例如如 J. A. Malona, K. Cariou, W. T. Spencer III, A. J. Frontier, J. Org. Chem. 2012, 77, 1891-1908 所述使各种亲核试剂与式 (B-2) 的中间体反应而得到式 (B-4) 的单-或二取代醇。

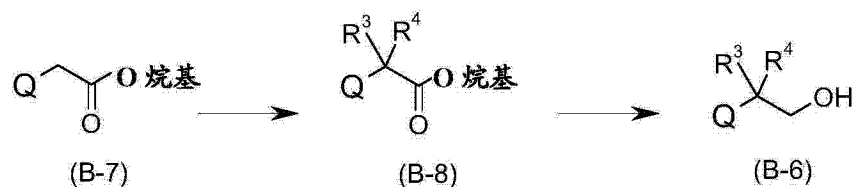
[0457] 可以如 WO 2012/085645 所述借助例如经由甲磺酰化或甲苯磺酰化活化羟基而使式 (B-3) 或 (B-4) 化合物转化成式 (B-5) 化合物。或者, 它们可以如 WO 2012/022487 所述用三溴化磷处理而将羟基转化成相应溴化物。

[0458] 其中  $p = 1$  的式 (B) 化合物如 (B-6)、(B-11)、(B-12) 或 (B15) 可以如方案 D-F 所示由式 (B-7)、(B-9) 或 (B-13) 的相应羧酸衍生物开始得到。

[0459] 例如如 WO 2012/058134 所述,  $\alpha$ -烷基化可以用于引入  $R^3$  和  $R^4$  取代基。例如如 A. K. Ghosh, C. D. Martyr, C. -X. Xu, Org. Lett. 2012, 14, 2002-2005 所述, 取代基  $R^1$  和  $R^2$  例如可以通过用例如氢化物试剂或格利雅试剂处理式 (B-8)、(B-9)、(B-10) 或 (B-14) 化合物而引入。

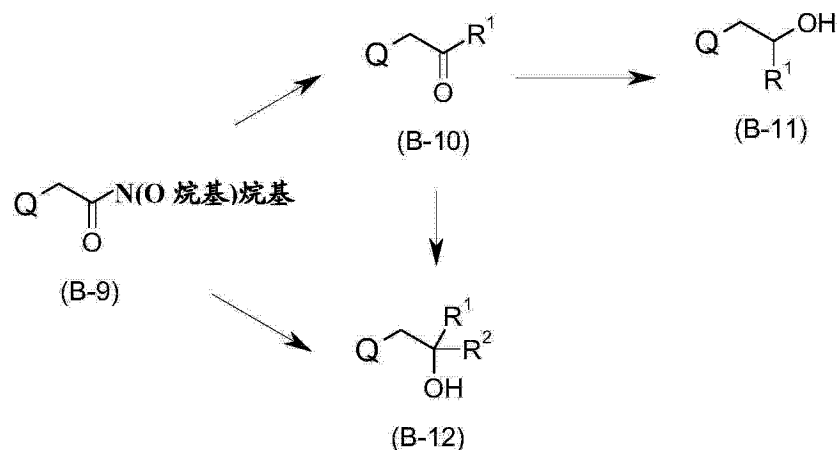
[0460] 方案 D.

[0461]



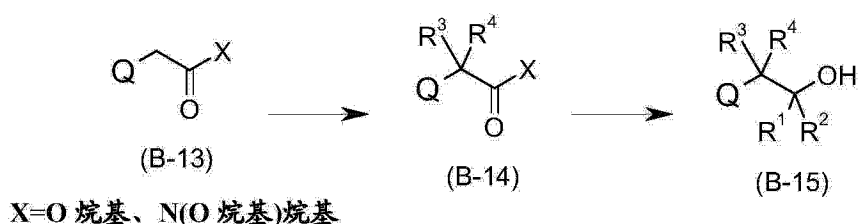
[0462] 方案 E.

[0463]



[0464] 方案 F.

[0465]



[0466] 式 (B-6)、(B-11)、(B-12) 或 (B15) 的醇可以通过如上所述的类似方法进一步活



化。

[0467] 式 (B-7)、(B-9) 或 (B-13) 化合物所需的式 (A-1) 的碘代化合物, 式 (B-1) 的氯代、溴代或碘代化合物以及羧酸衍生物可以购买或者根据已知文献方法合成。

[0468] 通常而言, 式 (I) 化合物可以通过如上所述的方法制备。若各化合物不能经由上述途径制备, 则可以通过衍生其他化合物 (I) 或通过所述合成途径的常规改性制备它们。例如, 在单独情况下, 某些化合物 (I) 可以有利地通过酯水解、酰胺化、酯化、醚裂解、烯烃化、还原、氧化等而由其他式 (I) 化合物制备。

[0469] 反应混合物以常规方式后处理, 例如通过与水混合、分离各相并且合适的话通过层析, 例如在矾土或硅胶上层析而提纯粗产物。一些中间体和终产物可以以无色或浅棕色粘稠油形式得到, 将它们在减压和温和升高的温度下除去或提纯挥发性组分。若中间体和终产物以固体得到, 则它们可以通过用合适溶剂重结晶或研制提纯。

[0470] 在本发明的一个方面, 提供了一种制备本发明式 (I) 化合物或其盐或 N-氧化物的方法, 包括使式 (XI) 化合物与式 (XII) 化合物任选在碱存在下反应的步骤。

[0471] 在一个实施方案中, 式 (XI) 化合物与式 (XII) 化合物的反应在没有碱存在下进行。

[0472] 在优选实施方案中, 式 (XI) 化合物与式 (XII) 化合物的反应在碱存在下进行。

[0473] 优选、更优选、甚至更优选和特别优选的式 (XI) 化合物是导致相应优选、更优选、甚至更优选和特别优选式 (I) 化合物的那些。

[0474] 优选、更优选、甚至更优选和特别优选的式 (XII) 化合物是导致相应优选、更优选、甚至更优选和特别优选式 (I) 化合物的那些。

[0475] 优选如下式 (XII) 化合物, 其中

[0476] L 为卤素或  $OS(O)_2R^*$ ; 以及

[0477]  $R^*$  为  $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_6$  卤代烷基、 $C_1-C_6$  硝基烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_3-C_6$  环烷基、苯基或苯基- $C_1-C_6$  烷基, 其中各苯基独立地未被取代或被至多 5 个选自卤素、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_6$  卤代烷基或  $C_1-C_6$  烷氧基的取代基取代。

[0478] 特别优选如下式 (XII) 化合物, 其中

[0479] L 为 Cl、Br、I 或  $OS(O)_2R^*$ ; 以及

[0480]  $R^*$  为  $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_6$  卤代烷基或苯基, 其中苯基未被取代或被至多 5 个选自卤素、 $NO_2$ 、 $C_1-C_6$  烷基或  $C_1-C_6$  烷氧基的取代基取代。

[0481] 非常特别优选如下式 (XII) 化合物, 其中

[0482] L 为 Cl、Br 或  $OS(O)_2R^*$ ; 以及

[0483]  $R^*$  为 Me、 $CF_3$ 、 $C_4F_9$ 、苯基或甲基。

[0484] 式 (XI) 化合物与式 (XII) 化合物的摩尔比通常为 1:0.5-2, 优选 1:0.5-1.5, 更优选 1:0.8-1.2。

[0485] 合适的碱是碳酸盐如碳酸锂、碳酸钠、碳酸钾、碳酸铯、碳酸镁、碳酸钙、碳酸钡; 碳酸氢盐如碳酸氢锂、碳酸氢钠、碳酸氢钾; 氢氧化物如氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化镁、氢氧化钙、氢氧化钡、氢氧化铝; 氧化物如氧化锂、氧化钠、氧化钾、氧化镁、氧化钙、氧化钡、氧化铁、氧化银; 氢化物如氢化锂、氢化钠、氢化钾、氢化钙; 磷酸盐如磷酸钾、磷酸钙; 醇盐如钠、钾或镁醇盐; 含氮碱如三乙胺、三甲胺、N-乙基二异丙基胺、三异丙基胺、氨、

吡啶、卢剔啶、可力丁、4-(二甲氨基)吡啶(DMAP)、咪唑、1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯(DBU)或1,5-二氮杂双环[4.3.0]壬-5-烯(DBN)。

[0486] 优选的碱包括碳酸盐和氢化物。

[0487] 特别优选的碱包括碳酸钾、碳酸铯和氢氧化钠。

[0488] 本文所用术语碱还包括两种或更多种,优选两种上述化合物的混合物。特别优选使用一种碱。

[0489] 式(XI)化合物与碱的摩尔比通常为1:0.8-3,优选1:1-2,更优选1:1-1.5。

[0490] 优选式(XI)化合物与式(XII)化合物在碱存在下的反应在溶剂中进行。

[0491] 合适溶剂的实例是偶极非质子溶剂,如N,N-二甲基甲酰胺(DMF)、N,N-二甲基乙酰胺(DMAc)、1-甲基-2-吡咯烷酮(NMP)、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮(DMI)、N,N'-二甲基亚丙基脲(DMPU)、二甲亚砜(DMSO)、环丁砜、乙腈、苯甲腈、丙酮、甲基乙基酮、甲基丁基酮、甲基异丁基酮、环己酮、硝基甲烷、硝基乙烷、硝基苯;酯类如乙酸乙酯、乙酸丁酯、乙酸异丁酯;醚类,如乙醚、二丁醚、叔丁基甲基醚(TBME)、1,2-二甲氧基乙烷、四氢呋喃(THF)、环戊基甲基醚、1,4-二噁烷;醇类,如甲醇、乙醇、异丙醇、1-丁醇、2-丁醇、异丁醇、叔丁醇、六氟异丙醇;卤代烃类,如二氯甲烷、二氯乙烷、四氯化碳;脂族烃类,如己烷、环己烷;芳族烃类,如苯、甲苯、二甲苯类、**菜**、氯苯。

[0492] 优选的溶剂包括丙酮、DMF、DMAc、1,2-二甲氧基乙烷、DMI、二氯甲烷、乙醚和THF。

[0493] 特别优选的溶剂包括丙酮、乙醚和THF。

[0494] 本文所用术语溶剂还包括两种或更多种上述化合物的混合物。

[0495] 式(XI)化合物与式(XII)化合物在碱存在下的反应通常在-40℃至80℃,优选-20℃至40℃,更优选0-30℃的温度下进行。

[0496] 害虫

[0497] 优选的动物害虫是无脊椎动物害虫。

[0498] 本文所用术语“无脊椎动物害虫”包括动物种群,如节肢动物害虫,包括昆虫和蜘蛛,以及线虫,它们可能侵袭植物,从而对被侵袭植物产生显著损害,以及可能侵染动物,尤其是温血动物如哺乳动物或鸟类或其他高等动物如爬行动物、两栖动物或鱼类,从而对被侵染动物产生显著损害的体外寄生虫。

[0499] 式I化合物、其盐及其N-氧化物尤其适合有效防治节肢动物害虫如蜘蛛、蜈蚣(myriapedes)和昆虫以及线虫。

[0500] 式I化合物尤其适合有效防治下列害虫:

[0501] 鳞翅目昆虫(鳞翅目(Lepidoptera)),例如桑剑纹夜蛾(*Acronicta major*)、苹卷蛾(*Adoxophyes orana*)、烦夜蛾(*Aedia leucomelas*);地老虎属(*Agrotis* spp.),如燕青地老虎(*Agrotis fucosa*)、黄地老虎(*Agrotis segetum*)、小地老虎(*Agrotis ypsilon*);棉叶波纹夜蛾(*Alabama argillacea*)、黎豆夜蛾(*Anticarsia gemmatalis*)、干煞夜蛾属(*Anticarsia* spp.)、苹果银蛾(*Argyresthia conjugella*)、丫纹夜蛾(*Autographa gamma*)、甘蓝夜蛾(*Barathra brassicae*)、棉叶穿孔潜蛾(*Bucculatrix thurberiella*)、松尺蠖(*Bupalus piniarius*)、枞卷叶蛾(*Cacoecia murinana*)、黄尾卷叶蛾(*Cacoecia podana*)、*Capua reticulana*、苹蠹蛾(*Carpocapsa pomonella*)、冬尺蛾(*Cheimatobia brumata*);禾草螟属(*Chilo* spp.),如二化螟(*Chilo suppressalis*);

枞色卷蛾 (*Choristoneura fumiferana*)、云杉芽卷蛾 (*Choristoneura occidentalis*)、粘虫 (*Cirphis unipuncta*)、葡萄果蠹蛾 (*Clysia ambiguella*)、*Cnaphalocerus* spp.、苹果小卷蛾 (*Cydia pomonella*)、松毛虫 (*Dendrolimus pini*)、*Diaphania nitidalis*、西南玉米秆草螟 (*Diatraea grandiosella*)、埃及钻夜蛾 (*Earias insulana*)、南美玉米苗斑螟 (*Elasmopalpus lignosellus*)、干果粉斑螟 (*Ephestia cautella*)、地中海粉斑螟 (*Ephestia kuehniella*)、女贞细卷蛾 (*Eupoecilia ambiguella*)、黄毒蛾 (*Euproctis chrysorrhoea*)、切根虫属 (*Euxoa* spp.)、*Evetria bouliana*；脏切夜蛾属 (*Feltia* spp.)，如粒肤地虎 (*Feltia subterranean*)；蜡螟 (*Galleria mellonella*)、李小食心虫 (*Grapholitha funebrana*)、梨小食心虫 (*Grapholitha molesta*)；*Helicoverpa* spp.，如棉铃虫 (*Helicoverpa armigera*)、美洲棉铃虫 (*Helicoverpa zea*)；实夜蛾属 (*Heliothis* spp.)，如棉铃虫 (*Heliothis armigera*)、烟芽夜蛾 (*Heliothis virescens*)、玉米穗虫 (*Heliothis zea*)；菜螟 (*Hellula undalis*)、*Hibernia defoliaria*、褐织蛾 (*Hofmannophila pseudospretella*)、茶长卷蛾 (*Homona magnanima*)、美国白蛾 (*Hyphantria cunea*)、樱桃巢蛾 (*Hyponomeuta padella*)、苹果巢蛾 (*Hyponomeuta malinellus*)、番茄虫蛾 (*Keiferia lycopersicella*)、铁杉尺蠖蛾 (*Lambdina fiscellaria*)；贪夜蛾属 (*Laphygma* spp.)，如甜菜夜蛾 (*Laphygma exigua*)；咖啡潜叶蛾 (*Leucoptera coffeella*)、旋纹潜蛾 (*Leucoptera scitella*)、苹果斑幕潜叶蛾 (*Lithocolletis blancardella*)、绿果冬夜蛾 (*Lithophane antennata*)、葡萄浆果小卷蛾 (*Lobesia botrana*)、豆白隆切根虫 (*Loxagrotis albicosta*)、甜菜网螟 (*Loxostege sticticalis*)；毒蛾属 (*Lymantria* spp.)，如舞毒蛾 (*Lymantria dispar*)、模毒蛾 (*Lymantria monacha*)；桃潜蛾 (*Lyonetia clerkella*)、黄褐天幕毛虫 (*Malacosoma neustria*)；*Mamestra* spp.，如甘蓝夜蛾 (*Mamestra brassicae*)；稻毛胫夜蛾 (*Mocis repanda*)、粘虫 (*Mythimna separata*)、*Orgyia pseudotsugata*；*Oria* spp.；秆野螟属 (*Ostrinia* spp.)，如欧洲玉米螟 (*Ostrinia nubilalis*)；稻负泥虫 (*Oulema oryzae*)、小眼夜蛾 (*Panolis flammea*)；红铃虫属 (*Pectinophora* spp.)，如棉花红铃虫 (*Pectinophora gossypiella*)；疆夜蛾 (*Peridroma saucia*)、圆掌舟蛾 (*Phalera bucephala*)；烟尺蛾属 (*Phthorimaea* spp.)，如马铃薯麦蛾 (*Phthorimaea operculella*)；柑桔潜叶蛾 (*Phyllocnistis citrella*)；菜粉蝶属 (*Pieris* spp.)，如欧洲粉蝶 (*Pieris brassicae*)、菜粉蝶 (*Pieris rapae*)；苜蓿绿夜蛾 (*Plathypena scabra*)、菜蛾 (*Plutella maculipennis*)、小菜蛾 (*Plutella xylostella*)、斜纹夜蛾属 (*Prodenia* spp.)、粘虫属 (*Pseudaletia* spp.)、大豆夜蛾 (*Pseudoplusia includens*)、玉米螟 (*Pyrausta nubilalis*)、*Rhyacionia frustrana*、*Scrobipalpula absoluta*、麦蛾 (*Sitotroga cerealella*)、葡萄卷叶蛾 (*Sparganothis pilleriana*)；灰翅夜蛾属 (*Spodoptera* spp.)，如草地夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*)、海灰翅夜蛾 (*Spodoptera littoralis*)、斜纹夜蛾 (*Spodoptera litura*)；*Thaumatopoea pityocampa*、*Thermesia gemmatilis*、袋谷蛾 (*Tinea pellionella*)、幕谷蛾 (*Tineola bisselliella*)、栎绿卷蛾 (*Tortrix viridana*)；粉夜蛾属 (*Trichoplusia* spp.)，如粉纹夜蛾 (*Trichoplusia ni*)；*Tuta absoluta* 和 *Zeiraphera canadensis*；

[0502] 甲虫 (鞘翅目)，例如菜豆象 (*Acanthoscehdus obtectus*)、喙丽金龟属 (*Adoretus*

spp.)、杨树萤叶甲 (*Agelastica alni*)、梨窄吉丁 (*Agrilus sinuatus*) ;叩甲属 (*Agriotes* spp.) ,如细胸叩头虫 (*Agriotes fuscicollis*)、条叩头虫 (*Agriotes lineatus*)、暗色叩头虫 (*Agriotes obscurus*) ;*Amphimallus solstitialis*、*Anisandrus dispar*、家具窃蠹 (*Anobium punctatum*)、红铜丽金龟 (*Anomala rufocuprea*) ;星天牛属 (*Anoplophora* spp.) ,如光肩星天牛 (*Anoplophora glabripennis*) ;花象甲属 (*Anthonomus* spp.) ,如棉铃象甲 (*Anthonomus grandis*)、苹花象 (*Anthonomus pomorum*) ;圆皮蠹属 (*Anthrenus* spp.)、*Aphthona euphoridae* ;阿鳃金龟属 (*Apogonia* spp.) ;*Athous haemorrhoidalis* ;*Atomaria* spp. ,如甜菜隐食甲 (*Atomaria linearis*) ;毛皮蠹属 (*Attagenus* spp.) ;黄守瓜 (*Aulacophora femoralis*)、纵坑切梢小蠹 (*Blastophagus piniperda*)、*Blitophaga undata*、*Bruchidius obtectus* ;豆象属 (*Bruchus* spp.) ,如欧洲兵豆象 (*Bruchus lentis*)、豌豆象 (*Bruchus pisorum*)、蚕豆象 (*Bruchus rufimanus*) ;苹卷象 (*Byctiscus betulae*)、绿豆象 (*Callosobruchus chinensis*)、甜菜大龟甲 (*Cassida nebulosa*)、豆叶甲 (*Cerotoma trifurcata*)、金花金龟 (*Cetonia aurata*) ;龟象属 (*Ceuthorhynchus* spp.) ,如白菜籽龟象 (*Ceuthorhynchus assimilis*)、芜菁龟象 (*Ceuthorhynchus napi*) ;甜菜胫跳甲 (*Chaetocnema tibialis*)、*Cleonus mendicus* ;宽胸叩头虫属 (*Conoderus* spp.) ,如烟草金针虫 (*Conoderus vespertinus*) ;根颈象属 (*Cosmopolites* spp.)、新西兰草地蛴螬 (*Costelytra zealandica*)、石刁柏负泥虫 (*Crioceris asparagi*)、杨干隐喙象 (*Cryptorhynchus lapathi*) ;*Ctenicera* spp. ,如 *Ctenicera destructor* ;象虫属 (*Curculio* spp.)、蛀茎虫 (*Dectes texanus*)、皮蠹属 (*Dermestes* spp.) ;叶甲属 (*Diabrotica* spp.) ,如 *Diabrotica 12-punctata*、南美叶甲 (*Diabrotica speciosa*)、长角叶甲 (*Diabrotica longicornis*)、*Diabrotica semipunctata*、玉米根萤叶甲 (*Diabrotica virgifera*) ;食植瓢虫属 (*Epilachna* spp.) ,如墨西哥豆瓢虫 (*Epilachna varivestis*)、马铃薯瓢虫 (*Epilachna vigintioctomaculata*) ;毛跳甲属 (*Epitrix* spp.) ,如烟草跳甲 (*Epitrix hirtipennis*) ;棉灰蒙象变种 (*Eutinobothrus brasiliensis*)、烟草钻孔虫 (*Faustinus cubae*)、*Gibbium psylloides*、非洲独角仙 (*Heteronychus arator*)、*Hylamorpha elegans*、欧洲松树皮象 (*Hylobius abietis*)、家天牛 (*Hylotrupes bajulus*)、埃及苜蓿叶象 (*Hypera brunneipennis*)、紫苜蓿叶象 (*Hypera postica*)、果小蠹属 (*Hypothenemus* spp.)、云杉八齿小蠹 (*Ips typographus*)、*Lachnosterna consanguinea*、烟草负泥虫 (*Lema bilineata*)、黑角负泥虫 (*Lema melanopus*) ;马铃薯叶甲属 (*Leptinotarsa* spp.) ,如马铃薯叶甲 (*Leptinotarsa decemlineata*) ;甜菜叩甲 (*Limonius californicus*)、稻水象甲 (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、稻水象甲 (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、筒喙象属 (*Lixus* spp.) ;粉蠹属 (*Lyctus* spp.) ,如褐粉蠹 (*Lyctus bruneus*) ;*Melanotus communis* ;菜花露尾甲属 (*Meligethes* spp.) ,如油菜露尾甲 (*Meligethes aeneus*) ;大栗鳃金龟 (*Melolontha hippocastani*)、五月鳃金龟 (*Melolontha melolontha*)、*Migdolus* spp. ;墨天牛属 (*Monochamus* spp.) ,如松墨天牛 (*Monochamus alternatus*) ;*Naupactus xanthographus*、黄蛛甲 (*Niptus hololeucus*)、椰蛀犀金龟 (*Oryctes rhinoceros*)、锯谷盗 (*Oryzaeophilus surinamensis*)、黑葡萄耳象 (*Otiorrhynchus sulcatus*)、草莓根象甲 (*Otiorrhynchus ovatus*)、黑葡萄耳象 (*Otiorrhynchus sulcatus*)、水稻负泥虫 (*Oulema oryzae*)、小青花金龟 (*Oxycetonia*

jucunda)、辣根猿叶甲 (*Phaedon cochleariae*)、梨树叶象 (*Phyllobius pyri*)、庭园发丽金龟 (*Phyllopertha horticola*) ;食叶鳃金龟属 (*Phyllophaga* spp.) ;条跳甲属 (*Phyllotreta* spp.) ,如 *Phyllotreta chrysocephala*、大豆淡足跳甲 (*Phyllotreta nemorum*)、黄曲条菜跳甲 (*Phyllotreta striolata*) ;食叶鳃金龟属 (*Phyllophaga* spp.)、庭园发丽金龟 (*Phyllopertha horticola*)、日本金龟子 (*Popillia japonica*)、小象甲属 (*Premnotrypes* spp.)、油菜蓝跳甲 (*Psylliodes chrysocephala*)、蛛甲属 (*Ptinus* spp.)、暗色瓢虫 (*Rhizobius ventralis*)、谷蠹 (*Rhizopertha dominica*)、豌豆叶象 (*Sitona lineatus*) ;谷象属 (*Sitophilus* spp.) ,谷象 (*Sitophilus granaria*)、玉米象 (*Sitophilus zeamais*) ;尖隐喙象属 (*Sphenophorus* spp.) ,如 *Sphenophorus levis* ;茎干象属 (*Sternechus* spp.) ,如 *Sternechus subsignatus* ;*Symphyletes* spp.、黄粉虫 (*Tenebrio molitor*) ;拟谷盗属 (*Tribolium* spp.) ,如赤拟谷盗 (*Tribolium castaneum*) ;斑皮蠹属 (*Trogoderma* spp.)、籽象属 (*Tychius* spp.)、脊虎天牛属 (*Xylotrechus* spp.) 和距步甲属 (*Zabrus* spp.) ,如 *Zabrus tenebrioides* ;

[0503] 蝇、蚊 (双翅目 (Diptera)) ,例如伊蚊属 (*Aedes* spp.) ,如埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*)、白纹伊蚊 (*Aedes albopictus*)、刺扰伊蚊 (*Aedes vexans*) ;墨西哥果蝇 (*Anastrepha ludens*) ;按蚊属 (*Anopheles* spp.) ,如白足按蚊 (*Anopheles albimanus*)、灾难按蚊 (*Anopheles crucians*)、费氏按蚊 (*Anopheles freeborni*)、冈比亚按蚊 (*Anopheles gambiae*)、白踝按蚊 (*Anopheles leucosphyrus*)、五斑按蚊 (*Anopheles maculipennis*)、微小按蚊 (*Anopheles minimus*)、四斑按蚊 (*Anopheles quadrimaculatus*)、中华按蚊 (*Anopheles sinensis*) ;花园毛蚊 (*Bibio hortulanus*)、绿头蝇 (*Calliphora erythrocephala*)、红头丽蝇 (*Calliphora vicina*)、*Cerafitis capitata*、地中海实蝇 (*Ceratitidis capitata*) ;金蝇属 (*Chrysomya* spp.) ,如蛆症金蝇 (*Chrysomya bezziana*)、*Chrysomya hominivorax*、腐败金蝇 (*Chrysomya macellaria*) ;*Chrysops atlanticus*、鹿蝇 (*Chrysops discalis*)、静斑虻 (*Chrysops silacea*) ;锥蝇属 (*Cochliomyia* spp.) ,如螺旋蝇 (*Cochliomyia hominivorax*) ;瘿蚊属 (*Contarinia* spp.) ,如高粱瘿蚊 (*Contarinia sorghicola*) ;嗜人瘤蝇蛆 (*Cordylobia anthropophaga*) ;库蚊属 (*Culex* spp.) ,如斑蚊 (*Culex nigripalpus*)、尖音库蚊 (*Culex pipiens*)、致倦库蚊 (*Culex quinquefasciatus*)、媒斑蚊 (*Culex tarsalis*)、三带喙库蚊 (*Culex tritaeniorhynchus*) ;狂怒库蚊 (*Culicoides furens*)、无饰脉毛蚊 (*Culiseta inornata*)、黑尾脉毛蚊 (*Culiseta melanura*)、黄蝇属 (*Cuterebra* spp.)、瓜蝇 (*Dacus cucurbitae*)、油橄榄实蝇 (*Dacus oleae*)、油菜叶瘿蚊 (*Dasineura brassicae*) ;地种蝇属 (*Delia* spp.) ,如葱蝇 (*Delia antique*)、麦地种蝇 (*Delia coarctata*)、灰地种蝇 (*Delia platura*)、甘蓝地种蝇 (*Delia radicum*) ;人肤皮蝇 (*Dermatobia hominis*)、果蝇属 (*Drosophila* spp.) ;厕蝇属 (*Fannia* spp.) ,如小毛厕蝇 (*Fannia canicularis*) ;胃蝇属 (*Gastrophilus* spp.) ,如马蝇 (*Gasterophilus intestinalis*) ;*Geomyza Tripunctata*、*Glossina fuscipes*、刺舌蝇 (*Glossina morsitans*)、须舌蝇 (*Glossina palpalis*)、胶舌蝇 (*Glossina tachinoides*)、扰血蝇 (*Haematobia irritans*)、*Haplodiplosis equestris*、潜蝇属 (*Hippelates* spp.) ;黑蝇属 (*Hylemyia* spp.) ,如花生田灰地种蝇 (*Hylemyia platura*) ;皮蝇属 (*Hypoderma* spp.) ,如纹皮蝇 (*Hypoderma lineata*) ;*Hyppobosca* spp.、*Leptoconops torrens* ;斑潜

蝇属 (*Liriomyza* spp.), 如美洲斑潜蝇 (*Liriomyza sativae*)、美国潜叶蝇 (*Liriomyza trifolii*); 绿蝇属 (*Lucilia* spp.), 如 *Lucilia caprina*、铜绿蝇 (*Lucilia cuprina*)、丝光绿蝇 (*Lucilia sericata*); *Lycoria pectoralis*、*Mansonia titillanus*; 瘿蚊属 (*Mayetiola* spp.), 如麦瘿蚊 (*Mayetiola destructor*); 家蝇属 (*Musca* spp.), 如秋家蝇 (*Musca autumnalis*)、家蝇 (*Musca domestica*); 厩腐蝇 (*Muscina stabulans*)、狂蝇属 (*Oestrus* spp.), 如羊狂蝇 (*Oestrus ovis*); *Opomyza florum*; *Oscinella* spp., 如瑞典麦秆蝇 (*Oscinella frit*); 天仙子泉蝇 (*Pegomya hysocyami*)、银足白蛉 (*Phlebotomus argentipes*); 草种蝇属 (*Phorbia* spp.), 如葱蝇 (*Phorbia antiqua*)、萝卜蝇 (*Phorbia brassicae*)、麦地种蝇 (*Phorbia coarctata*); *Prosimulium mixtum*、胡萝卜茎蝇 (*Psila rosae*)、哥伦比亚鳞蚊 (*Psorophora columbiae*)、*Psorophora discolor*、樱桃实蝇 (*Rhagoletis cerasi*)、苹果实蝇 (*Rhagoletis pomonella*); 麻蝇属 (*Sarcophaga* spp.), 如赤尾麻蝇 (*Sarcophaga haemorrhoidalis*); 带蚋 (*Simulium vittatum*); 螫蝇属 (*Stomoxys* spp.), 如厩螫蝇 (*Stomoxys calcitrans*); 虻属 (*Tabanus* spp.), 如北美黑虻 (*Tabanus atratus*)、牛虻 (*Tabanus bovinus*)、红色原虻 (*Tabanus lineola*)、二毛虫 (*Tabanus similis*); *Tannia* spp.、*Tipula oleracea*、欧洲大蚊 (*Tipula paludosa*) 和污蝇属 (*Wohlfahrtia* spp.);

[0504] 蓟马 (缨翅目 (*Thysanoptera*)), 例如稻蓟马 (*Baliothrips biformis*)、兰花蓟马 (*Dichromothrips corbetti*)、*Dichromothrips* ssp.、*Enneothrips flavens*、花蓟马属 (*Frankliniella* spp.), 如烟褐蓟马 (*Frankliniella fusca*)、苜蓿花蓟马 (*Frankliniella occidentalis*)、东方花蓟马 (*Frankliniella tritici*); 阳蓟马属 (*Heliothrips* spp.)、温室蓟马 (*Hercinothrips femoralis*)、卡蓟马属 (*Kakothrips* spp.)、腹突皱针蓟马 (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、腹突皱针蓟马 (*Rhipiphorothrips cruentatus*); 硬蓟马属 (*Scirtothrips* spp.), 如桔硬蓟马 (*Scirtothrips citri*); *Taeniothrips cardamoni*; 蓟马属 (*Thrips* spp.), 如稻蓟马 (*Thrips oryzae*)、棕榈蓟马 (*Thrips palmi*) 和烟蓟马 (*Thrips tabaci*);

[0505] 白蚁 (等翅目 (*Isoptera*)), 例如黄颈木白蚁 (*Calotermes flavicollis*)、台湾乳白蚁 (*Coptotermes formosanus*)、金黄异白蚁 (*Heterotermes aureus*)、长头异白蚁 (*Heterotermes longiceps*)、甘蔗白蚁 (*Heterotermes tenuis*)、*Leucotermes flavipes*、土白蚁属 (*Odontotermes* spp.); 散白蚁属 (*Reticulitermes* spp.), 如黄胸散白蚁 (*Reticulitermes speratus*)、黄肢散白蚁 (*Reticulitermes flavipes*)、*Reticulitermes grassei*、欧洲散白蚁 (*Reticulitermes lucifugus*)、*Reticulitermes santonensis*、美小黑散白蚁 (*Reticulitermes virginicus*); *Termes natalensis*;

[0506] 蟑螂 (蜚蠊目 (*Blattaria*)-*Blattodea*), 例如家蟋蟀 (*Acheta domesticus*)、东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*)、*Blattella asahinae*、德国小蠊 (*Blattella germanica*)、蝼蛄属 (*Gryllotalpa* spp.)、马德拉蜚蠊 (*Leucophaea maderae*)、飞蝗属 (*Locusta* spp.)、蚱蜢属 (*Melanoplus* spp.)、美洲大蠊 (*Periplaneta americana*)、澳洲蜚蠊 (*Periplaneta australasiae*)、棕色蜚蠊 (*Periplaneta brunnea*)、黑胸大蠊 (*Periplaneta fuliginosa*)、日本大蠊 (*Periplaneta japonica*);

[0507] 臭虫、蚜虫、叶蝉、粉虱、蚧壳虫、蝉 (半翅目 (*Hemiptera*)), 例如 *Acrosternum*

spp., 如拟绿蝽 (*Acrosternum hilare*); 无网长管蚜属 (*Acyrtosiphon* spp.), 如 *Acyrtosiphon onobrychis*、豌豆蚜 (*Acyrtosiphon pisum*); 落叶松球蚜 (*Adelges laricis*)、沫蜂属 (*Aeneolamia* spp.)、隆脉木虱属 (*Agonosцена* spp.)、白粉虱属 (*Aleurodes* spp.)、甘蔗穴粉虱 (*Aleurolobus barodensis*)、丝绒粉虱属 (*Aleurothrixus* spp.)、杧果叶蝉属 (*Amrasca* spp.)、南瓜缘蝽 (*Anasa tristis*)、拟丽蝽属 (*Antestiopsis* spp.)、*Anuraphis cardui*、肾圆盾蚧属 (*Aonidiella* spp.)、梨瘤蚜 (*Aphanostigma piri*)、*Aphidula nasturtii*; 蚜属 (*Aphis* spp.), 如甜菜蚜 (*Aphis fabae*)、草莓根蚜 (*Aphis forbesi*)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)、北美茶藨子蚜 (*Aphis grossulariae*)、苹果蚜 (*Aphis pomi*)、接骨木蚜 (*Aphis sambuci*)、希奈德蚜 (*Aphis schneideri*)、卷叶蚜 (*Aphis spiraecola*); 葡萄阿小叶蝉 (*Arboridia apicalis*)、轮背猎蝽 (*Arilus critatus*)、小圆盾蚧属 (*Aspidiella* spp.)、圆盾蚧属 (*Aspidiotus* spp.)、*Atanus* spp.、茄无网蚜 (*Aulacorthum solani*); 粉虱属 (*Bemisia* spp.), 如银叶粉虱 (*Bemisia argentifolii*)、烟粉虱 (*Bemisia tabaci*); 土长蝽属 (*Blissus* spp.), 如玉米长蝽 (*Blissus leucopterus*); 飞廉短尾蚜 (*Brachycaudus cardui*)、李短尾蚜 (*Brachycaudus helichrysi*)、桃短尾蚜 (*Brachycaudus persicae*)、*Brachycaudus prunicola*、微管蚜属 (*Brachycolus* spp.)、甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*)、小褐稻虱 (*Calligypona marginata*)、俊盲蝽属 (*Calocoris* spp.)、斑腿微刺盲蝽 (*Campylomma livida*)、*Capitophorus horni*、*Carnecephala fulgida*、异背长蝽属 (*Cavelerius* spp.)、龟蜡蚧 (*Ceroplastes* spp.)、甘蔗绵蚜 (*Ceratovacuna lanigera*)、沫蝉科 (*Cercopidae*)、*Cerosipha gossypii*、草莓中瘤钉毛蚜 (*Chaetosiphon fragaefolii*)、蔗黄雪盾蚧 (*Chionaspis tegalensis*)、茶绿叶蝉 (*Chlorita onukii*)、核桃黑斑蚜 (*Chromaphis juglandicola*)、黑褐圆盾蚧 (*Chrysomphalus ficus*)、玉米叶蝉 (*Cicadulina mbila*)、臭虫属 (*Cimex* spp.), 如热带臭虫 (*Cimex hemipterus*)、温带臭虫 (*Cimex lectularius*); *Coccomytilus halli*、软蚧属 (*Coccus* spp.)、*Creontiades dilutus*、茶藨子隐瘤蚜 (*Cryptomyzus ribis*)、茶藨隐瘤蚜 (*Cryptomyzus ribis*)、黑斑烟盲蝽 (*Cyrtopeltis notatus*)、*Dalbulus* spp.、胡椒缘蝽 (*Dasynus piperis*)、粉虱 (*Dialeurades* spp.)、木虱属 (*Diaphorina* spp.)、白背盾蚧属 (*Diaspis* spp.)、*Dichelops furcatus*、厚氏长棒网蝽 (*Diconocoris hewetti*)、*Doralis* spp.、高加索冷杉椎球蚜 (*Dreyfusia nordmannianae*)、云杉椎球蚜 (*Dreyfusia piceae*)、履绵蚧属 (*Drosicha* spp.); 西圆尾蚜属 (*Dysaphis* spp.), 如车前圆尾蚜 (*Dysaphis plantaginea*)、梨西圆尾蚜 (*Dysaphis pyri*)、居根西圆尾蚜 (*Dysaphis radicola*); *Dysaulacorthum pseudosolani*; 棉红蝽属 (*Dysdercus* spp.), 如棉红蝽 (*Dysdercus cingulatus*)、*Dysdercus intermedius*; 灰粉蚧属 (*Dysmicoccus* spp.); 小绿叶蝉属 (*Empoasca* spp.), 如蚕豆微叶蝉 (*Empoasca fabae*)、索拉纳小绿叶蝶 (*Empoasca solana*); 绵蚜属 (*Eriosoma* spp.)、斑叶蝉属 (*Erythroneura* spp.); 扁盾蝽属 (*Eurygaster* spp.), 如麦扁盾蝽 (*Eurygaster integriceps*); 钝鼻叶蝉 (*Euschelis bilobatus*); 美洲蝽属 (*Euschistus* spp.), 如大豆褐椿 (*Euschistus heros*)、烟草蝽 (*Euschistus impictiventris*)、褐臭蝽 (*Euschistus servus*); 咖啡地粉蚧 (*Geococcus coffeae*); 茶翅蝽属 (*Halyomorpha* spp.), 如茶翅蝽 (*Halyomorpha halys*); 角盲椿 (*Heliopeltis* spp.)、玻璃叶蝉 (*Homalodisca coagulata*)、*Horcias nobilellus*、李

大尾蚜 (*Hyalopterus pruni*)、茶蔗苦菜超瘤蚜 (*Hyperomyzus lactucae*)、吹绵蚧属 (*Icerya* spp.)、片角叶蝉属 (*Idiocerus* spp.)、扁喙叶蝉属 (*Idioscopus* spp.)、灰飞虱 (*Laodelphax striatellus*)、蜡蚧属 (*Lecanium* spp.)、蛎盾蚧属 (*Lepidosaphes* spp.)、稻缘蝽属 (*Leptocorisa* spp.)、棉红铃喙缘蝽 (*Leptoglossus phyllopus*)、萝卜蚜 (*Lipaphis erysimi*)；草盲蝽属 (*Lygus* spp.)，如草盲蝽 (*Lygus hesperus*)、美洲牧草盲蝽 (*Lygus lineolaris*)、牧草盲蝽 (*Lygus pratensis*)；蔗黑长蝽 (*Macropes excavatus*)；长管蚜属 (*Macrosiphum* spp.)，如蔷薇长管蚜 (*Macrosiphum rosae*)、麦长管蚜 (*Macrosiphum avenae*)、大戟长管蚜 (*Macrosiphum euphorbiae*)；*Mahanarva fimbriolata*、筛豆龟蝽 (*Megacocta cribraria*)、巢菜修尾蚜 (*Megoura viciae*)、*Melanaphis pyrarius*、高粱蚜 (*Melanaphis sacchari*)、*Metcafiella* spp.、麦无网蚜 (*Metopolophium dirhodum*)、盲蝽科 (*Miridae* spp.)、黑缘平翅斑蚜 (*Monellia costalis*)、*Monelliopsis pecanis*；瘤蚜属 (*Myzus* spp.)，如冬葱蚜 (*Myzus ascalonicus*)、李瘤蚜 (*Myzus cerasi*)、桃蚜 (*Myzus persicae*)、黄药子瘤蚜 (*Myzus varians*)；黑茶蔗子衲长管蚜 (*Nasonovia ribis-nigri*)；黑尾叶蝉属 (*Nephotettix* spp.)，如马来亚黑尾叶蝉 (*Nephotettix malayanus*)、二条黑尾叶蝉 (*Nephotettix nigropictus*)、细小黑尾叶蝉 (*Nephotettix parvus*)、二点黑尾叶蝉 (*Nephotettix virescens*)；绿蝽属 (*Nezara* spp.)，如稻绿蝽 (*Nezara viridula*)；褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*)、稻蝽属 (*Oebalus* spp.)、*Oncometopia* spp.、*Orthezia praelonga*、杨梅粉虱 (*Parabemisia myricae*)、*Paratrioza* spp.、片盾蚧属 (*Parlatoria* spp.)；瘿绵蚜属 (*Pemphigus* spp.)，如囊柄瘿绵蚜 (*Pemphigus bursarius*)；乌叶蝉科 (*Pentomidae*)、玉米蜡蝉 (*Peregrinus maidis*)、蔗飞虱 (*Perkinsiella saccharicida*)、绵粉蚧属 (*Phenacoccus* spp.)、杨平翅绵蚜 (*Phloeomyzus passerinii*)、忽布疣蚜 (*Phorodon humuli*)、葡萄根瘤蚜属 (*Phylloxera* spp.)、甜菜拟网蝽 (*Piesma quadrata*)；壁蝽属 (*Piezodorus* spp.)，如红蝽 (*Piezodorus guildinii*)、苏铁褐点并盾蚧 (*Pinnaspis aspidistrae*)、臀纹粉蚧属 (*Planococcus* spp.)、梨形原绵蚧 (*Protopulvinaria pyriformis*)、棉伪斑腿盲蝽 (*Psallus seriatus*)、*Pseudacysta perseae*、桑盾蚧 (*Pseudaulacaspis pentagona*)；粉蚧属 (*Pseudococcus* spp.)，如康氏粉蚧 (*Pseudococcus comstocki*)；木虱属 (*Psylla* spp.)，如苹果木虱 (*Psylla mali*)、梨木虱 (*Psylla piri*)；金小蜂属 (*Pteromalus* spp.)、*Pyrilla* spp.、笠圆盾蚧属 (*Quadraspidotus* spp.)、*Quesada gigas*、平刺粉蚧属 (*Rastrococcus* spp.)、*Reduvius senilis*、红猎蝽属 (*Rhodnius* spp.)、冬葱瘤蛾蚜 (*Rhopalomyzus ascalonicus*)；缢管蚜属 (*Rhopalosiphum* spp.)，如萝卜蚜 (*Rhopalosiphum pseudobrassicae*)、苹草缢管蚜 (*Rhopalosiphum insertum*)、玉米蚜 (*Rhopalosiphum maidis*)、禾谷缢管蚜 (*Rhopalosiphum padi*)；*Sagatodes* spp.、可可褐盲蝽 (*Sahlbergella singularis*)、黑盔蚧属 (*Saissetia* spp.)、*Sappaphis mala*、*Sappaphis mali*、葡萄带叶蝉 (*Scaphoides titanus*)、麦二叉蚜 (*Schizaphis graminum*)、*Schizoneura lanuginosa*、稻黑蝽属 (*Scotinophora* spp.)、刺盾蚧 (*Selenaspidus articulatus*)、禾谷网蚜 (*Sitobion avenae*)、长唇基飞虱属 (*Sogatata* spp.)、白背飞虱 (*Sogatella furcifera*)、*Solubea insularis*、梨冠网蝽 (*Stephanitis nashi*)、*Stictocephala festina*、*Tenalaphara malayensis*；*Thyanta* spp.，如 *Thyanta perditor*；*Tibraca* spp.、美洲山核桃长斑蚜 (*Tinocallis caryaefoliae*)、广胸沫蝉属 (*Tomaspis* spp.)；声蚜属



(Toxoptera spp.), 如桔二叉蚜 (*Toxoptera aurantii*); 白粉虱属 (*Trialeurodes* spp.), 如白粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*); 锥猎蝽属 (*Triatoma* spp.)、个木虱属 (*Trioza* spp.)、小叶蝉属 (*Typhlocyba* spp.); 尖盾蚧属 (*Unaspis* spp.), 如矢尖蚧 (*Unaspis yanonensis*); 和葡萄根瘤蚜 (*Viteus vitifolii*);

[0508] 蚂蚁、蜜蜂、黄蜂、锯蝇 (膜翅目 (Hymenoptera)), 例如新疆菜叶蜂 (*Athalia rosae*)、*Atta capiguara*、切叶蚁 (*Atta cephalotes*)、切叶蚁 (*Atta cephalotes*)、*Atta laevigata*、*Atta robusta*、*Atta sexdens*、*Atta texana*、熊蜂属 (*Bombus* spp.)、佛罗里达弓背蚁 (*Camponotus floridanus*)、举腹蚁属 (*Crematogaster* spp.)、天鹅绒蚂蚁 (*Dasymutilla occidentalis*)、松叶蜂属 (*Diprion* spp.)、姬胡蜂 (*Dolichovespula maculata*); 实蜂属 (*Hoplocampa* spp.), 如 *Hoplocampa minuta*、苹叶蜂 (*Hoplocampa testudinea*); 毛蚁属 (*Lasius* spp.), 如黑毛蚁 (*Lasius niger*); 阿根廷蚁 (*Linepithema humile*)、小黄家蚁 (*Monomorium pharaonis*)、*Paravespula germanica*、*Paravespula pennsylvanica*、*Paravespula vulgaris*、褐大头蚁 (*Pheidole megacephala*)、红蚂蚁 (*Pogonomyrmex barbatus*)、收割机蚂蚁 (*Pogonomyrmex californicus*)、胡蜂 (*Polistes rubiginosa*)、热带火蚁 (*Solenopsis geminata*)、红火蚁 (*Solenopsis invicta*)、黑火蚁 (*Solenopsis richteri*)、南方火蚁 (*Solenopsis xyloni*); 大胡蜂属 (*Vespa* spp.), 如黄边胡蜂 (*Vespa crabro*); 和大黄蜂 (*Vespula squamosa*);

[0509] 蟋蟀、蚱蜢、蝗虫 (直翅目 (Orthoptera)), 例如居屋艾蟋 (*Acheta domestica*)、意大利蝗 (*Calliptamus italicus*)、澳洲草栖蝗 (*Chortoicetes terminifera*)、摩洛哥戟纹蝗 (*Dociostaurus maroccanus*)、非洲蝼蛄 (*Gryllotalpa africana*)、蝼蛄 (*Gryllotalpa gryllotalpa*)、非洲蔗蝗 (*Hieroglyphus daganensis*)、印度黄檀蝗 (*Kraussaria angulifera*)、飞蝗 (*Locusta migratoria*)、褐色拟飞蝗 (*Locustana pardalina*)、双纹黑蝗 (*Melanoplus bivittatus*)、红足黑蝗 (*Melanoplus femurrubrum*)、墨西哥黑蝗 (*Melanoplus mexicanus*)、迁飞黑蝗 (*Melanoplus sanguinipes*)、石栖黑蝗 (*Melanoplus spretus*)、条纹红蝗 (*Nomadacris septemfasciata*)、塞纳加尔小车蝗 (*Oedaleus senegalensis*)、美洲沙漠蝗 (*Schistocerca americana*)、沙漠蝗 (*Schistocerca gregaria*)、庭疾灶螽 (*Tachycines asynamorus*) 和 *Zonozerus variegatus*;

[0510] 蜘蛛纲 (Arachnida), 如蜱螨目 (Acari), 例如软蜱科 (*Argasidae*)、硬蜱科 (*Ixodidae*) 和疥螨科 (*Sarcoptidae*), 例如花蜱属 (*Amblyomma* spp.) (例如长星形壁虱 (*Amblyomma americanum*)、热带花蜱 (*Amblyomma variegatum*)、斑点钝眼蜱 (*Amblyomma maculatum*))、锐缘蜱属 (*Argas* spp.) (例如波斯锐缘蜱 (*Argas persicus*))、牛蜱属 (*Boophilus* spp.) (例如牛壁虱 (*Boophilus annulatus*)、消色牛蜱 (*Boophilus decoloratus*)、微小牛蜱 (*Boophilus microplus*))、森林革蜱 (*Dermacentor silvarum*)、安氏革蜱 (*Dermacentor andersoni*)、美洲大革蜱 (*Dermacentor variabilis*)、璃眼蜱属 (*Hyalomma* spp.) (例如长喙璃眼蜱 (*Hyalomma truncatum*))、硬蜱属 (*Ixodes* spp.) (例如蓖子硬蜱 (*Ixodes ricinus*)、浅红硬蜱 (*Ixodes rubicundus*)、黑脚硬蜱 (*Ixodes scapularis*)、全环硬蜱 (*Ixodes holocyclus*)、太平洋硬蜱 (*Ixodes pacificus*))、钝缘蜱属 (*Ornithodoros* spp.) (例如毛白钝缘蜱 (*Ornithodoros moubata*)、赫氏钝缘蜱 (*Ornithodoros hermsi*)、回归热蜱 (*Ornithodoros turicata*))、柏氏禽刺

螨 (*Ornithonyssus bacoti*)、刺耳扁虱 (*Otobius megnini*)、鸡皮刺螨 (*Dermanyssus gallinae*)、痒螨属 (*Psoroptes* spp.) (例如绵羊疥病 (*Psoroptes ovis*))、扇头蜱属 (*Rhipicephalus* spp.) (例如血红扇头蜱 (*Rhipicephalus sanguineus*)、具尾扇头蜱 (*Rhipicephalus appendiculatus*)、外翻扇头蜱 (*Rhipicephalus evertsi*))、根螨属 (*Rhizoglyphus* spp.)、疥螨属 (*Sarcoptes* spp.) (例如人疥螨 (*Sarcoptes scabiei*))；和瘿螨科 (*Eriophyidae* spp.)，如 *Acaria sheldoni*；刺皮节蜱属 (*Aculops* spp.) (例如桔锈螨 (*Aculops pelekassi*))；刺瘿螨属 (*Aculus* spp.) (例如苹果刺锈螨 (*Aculus schlechtendali*))、枣叶锈螨 (*Epitrimerus pyri*)、桔皱叶刺瘿螨 (*Phyllocoptruta oleivora*) 和瘿螨属 (*Eriophyes* spp.) (例如柑橘瘿螨 (*Eriophyes sheldoni*))；跗绒螨属 (*Tarsonemidae* spp.)，如半跗线螨属 (*Hemitarsonemus* spp.)、*Phytonemus pallidus* 和侧多食跗线螨 (*Polyphagotarsonemus latus*)、狭跗线螨属 (*Stenotarsonemus* spp.)；细须螨属 (*Tenuipalpidae* spp.)，如短须螨属 (*Brevipalpus* spp.) (例如紫红短须螨 (*Brevipalpus phoenicis*))；叶螨属 (*Tetranychidae* spp.)，如始叶螨属 (*Eotetranychus* spp.)、真叶螨属 (*Eutetranychus* spp.)、小爪螨属 (*Oligonychus* spp.)、朱砂叶螨 (*Tetranychus cinnabarinus*)、神泽叶螨 (*Tetranychus kanzawai*)、太平洋叶螨 (*Tetranychus pacificus*)、棉叶螨 (*Tetranychus telarius*) 和二点叶螨 (*Tetranychus urticae*)；苜蓿苔螨 (*Bryobia praetiosa*)、全爪螨属 (*Panonychus* spp.) (例如苹果叶螨 (*Panonychus ulmi*)、橘全爪螨 (*Panonychus citri*))、*Metatetranychus* spp. 和小爪螨属 (*Oligonychus* spp.) (例如草地小爪螨 (*oligonychus pratensis*))、*Vasates lycopersici*；蜘蛛目 (*Araneida*)，例如毒蜘蛛 (*Latrodectus mactans*)、褐丝蛛 (*Loxosceles reclusa*) 以及粗脚粉螨 (*Acarus siro*)、皮螨属 (*Chorioptes* spp.)、中东金蝎 (*Scorpio maurus*)；

[0511] 跳蚤 (蚤目 (*Siphonaptera*))，例如角叶蚤属 (*Ceratophyllus* spp.)、猫跳蚤 (*Ctenocephalides felis*)、狗跳蚤 (*Ctenocephalides canis*)、印鼠客蚤 (*Xenopsylla cheopis*)、致痒蚤 (*Pulex irritans*)、穿皮潜蚤 (*Tunga penetrans*) 和具带病蚤 (*Nosopsyllus fasciatus*)；

[0512] 衣鱼、家衣鱼 (缨尾目 (*Thysanura*))，例如西洋衣鱼 (*Lepisma saccharina*) 和斑衣鱼 (*Thermobia domestica*)；

[0513] 百足虫 (唇足纲 (*Chilopoda*))，例如地蜈蚣属 (*Geophilus* spp.)、蚰蜒属 (*Scutigera* spp.) 如 *Scutigera coleoptrata*；

[0514] 千足虫 (倍足纲 (*Diplopoda*))，例如蚰蜒 (*Scutigera coleoptrata*)、*Narceus* spp.；

[0515] 蠃蛸 (革翅目 (*Dermaptera*))，例如欧洲球蠃 (*forficula auricularia*)，

[0516] 虱 (毛虱目 (*Phthiraptera*))，例如畜虱属 (*Damalinea* spp.)；人虱属 (*Pediculus* spp.)，如人头虱 (*Pediculus humanus capitis*)、人体虱 (*Pediculus humanus corporis*)；阴虱 (*Pthirus pubis*)；血虱属 (*Haematopinus* spp.)，如牛血虱 (*Haematopinus eurysternus*)、猪血虱 (*Haematopinus suis*)；颚虱属 (*Linognathus* spp.)，如犊颚虱 (*Linognathus vituli*)；牛虱 (*Bovicola bovis*)、鸡虱 (*Menopon gallinae*)、大鸡虱 (*Menacanthus stramineus*) 和水牛盲虱 (*Solenopotes capillatus*)，嚼虱属

(*Trichodectes* spp.);

[0517] 跳虫(弹尾目(*Collembola*)),例如棘跳虫属(*Onychiurus* spp.)如武装棘跳虫(*Onychiurus armatus*),

[0518] 它们还适于防治线虫:植物寄生性线虫如根结线虫,北方根结线虫(*Meloidogyne hapla*)、南方根结线虫(*Meloidogyne incognita*)、爪哇根结线虫(*Meloidogyne javanica*)和其他根结线虫属(*Meloidogyne*);胞囊线虫,马铃薯金线虫(*Globodera rostochiensis*)和其他球胞囊线虫属(*Globodera*);禾谷胞囊线虫(*Heterodera avenae*)、大豆胞囊线虫(*Heterodera glycines*)、甜菜胞囊线虫(*Heterodera schachtii*)、三叶草胞囊线虫(*Heterodera trifolii*)和其他胞囊线虫属(*Heterodera*);种子肿瘿线虫,粒线虫属(*Anguina*);茎叶线虫,滑刃线虫属(*Aphelenchoides*)如水稻干尖线虫(*Aphelenchoides besseyi*);刺线虫,杂草刺线虫(*Belonolaimus longicaudatus*)和其他针刺线虫属(*Belonolaimus*);松线虫,松材线虫(*Bursaphelenchus lignicolus* Mamiya et Kiyohara)、松材线虫(*Bursaphelenchus xylophilus*)和其他伞滑刃线虫属(*Bursaphelenchus*);环形线虫,环纹线虫属(*Criconema*)、小环线虫属(*Criconemella*)、轮线虫属(*Criconemoides*)、中环线虫属(*Mesocriconema*);球茎线虫,腐烂茎线虫(*Ditylenchus destructor*)、甘薯茎线虫(*Ditylenchus dipsaci*)和其他茎线虫属(*Ditylenchus*);锥线虫,锥线虫属(*Dolichodorus*);螺旋形线虫,多带螺旋(*Heliocotylenchus multicinctus*)和其他螺旋线虫属;鞘线虫,鞘线虫属(*Hemicycliophora*)和*Hemicriconemoides*属;*Hirshmanniella*属;冠线虫,纽带线虫(*Hoplolaimus*)属;假根结线虫,真珠线虫属(*Nacobbus*);针线虫,伸展长针线虫(*Longidorus elongatus*)和其他长针线虫属(*Longidorus*);根腐线虫,最短尾短体线虫(*Pratylenchus brachyurus*)、疏忽短体线虫(*Pratylenchus neglectus*)、穿刺短体线虫(*Pratylenchus penetrans*)、*Pratylenchus curvatus*、古迪短体线虫(*Pratylenchus goodeyi*)和其他短体线虫属(*Pratylenchus*);穿孔线虫,香蕉穿孔线虫(*Radopholus similis*)和其他穿孔线虫属(*Radopholus*);肾形线虫,盘旋线虫(*Rotylenchus robustus*)、肾形肾脏线虫(*Rotylenchulus reniformis*)和其他肾状线虫属(*Rotylenchulus*);盾线虫(*Scutellonema*)属;残根线虫,原始毛刺线虫(*Trichodorus primitivus*)和其他毛刺线虫属(*Trichodorus*)、类毛刺属(*Paratrichodorus*);阻长线虫,克莱顿矮化线虫(*Tylenchorhynchus claytoni*)、不定矮化线虫(*Tylenchorhynchus dubius*)以及其他矮化线虫属(*Tylenchorhynchus*);柑桔线虫,小垫刃线虫(*Tylenchulus*)属如柑桔半穿刺线虫(*Tylenchulus semipenetrans*);剑线虫,剑线虫属(*Xiphinema*);和其他植物寄生性线虫种属。

[0519] 可由式(I)化合物防治的其他害虫种属的实例包括:双壳纲(*Bivalva*),例如,饰贝属(*Dreissena* spp.);腹足纲(*Gastropoda*),例如阿勇蛞蝓属(*Arion* spp.)、双脐螺属(*Biomphalaria* spp.)、小泡螺属(*Bulinus* spp.)、*Deroceras* spp.、土蜗属(*Galba* spp.)、椎实螺属(*Lymnaea* spp.)、钉螺属(*Oncomelania* spp.)、琥珀螺属(*Succinea* spp.);蠕虫纲(*Helminths*),例如十二指肠钩口线虫(*Ancylostoma duodenale*)、斯里兰卡钩口线虫(*Ancylostoma ceylanicum*)、巴西钩口线虫(*Ancylostoma braziliense*)、钩口线虫属(*Ancylostoma* spp.)、似引蛔线虫(*Ascaris lubricoides*)、蛔虫属(*Ascaris*

spp.)、马来布鲁线虫 (*Brugia malayi*)、帝汶布鲁线虫 (*Brugia timori*)、仰口线虫属 (*Bunostomum* spp.)、夏伯特线虫属 (*Chabertia* spp.)、枝睾吸虫属 (*Clonorchis* spp.)、古柏线虫属 (*Cooperia* spp.)、双腔吸虫属 (*Dicrocoelium* spp.)、丝状网尾线虫 (*Dictyocaulus filaria*)、阔叶裂头绦虫 (*Diphyllobothrium latum*)、麦地那龙线虫 (*Dracunculus medinensis*)、细粒棘球绦虫 (*Echinococcus granulosus*)、多房棘球绦虫 (*Echinococcus multilocularis*)、蠕形住肠蛭虫 (*Enterobius vermicularis*)、片吸虫属 (*Faciola* spp.)、血矛线虫属 (*Haemonchus* spp.) 如捻转血矛线虫 (*Haemonchus contortus*)；异刺线虫属 (*Heterakis* spp.)、矮小啮壳绦虫 (*Hymenolepis nana*)、猪圆线虫属 (*Hyostrogylus* spp.)、罗阿罗阿线虫 (*Loa Loa*)、细颈线虫属 (*Nematodirus* spp.)、结节线虫属 (*Oesophagostomum* spp.)、后睾吸虫属 (*Opisthorchis* spp.)、旋盘尾丝虫 (*Onchocerca volvulus*)、奥斯脱线虫属 (*Ostertagia* spp.)、并殖吸虫属 (*Paragonimus* spp.)、血吸虫属 (*Schistosomen* spp.)、富氏类圆线虫 (*Strongyloides fuelleborni*)、粪类圆线虫 (*Strongyloides stercoralis*)、粪圆线虫属 (*Strongyloides* spp.)、牛带绦虫 (*Taenia saginata*)、猪带绦虫 (*Taenia solium*)、旋毛形线虫 (*Trichinella spiralis*)、本地毛形线虫 (*Trichinella nativa*)、株布氏旋毛虫 (*Trichinella britovi*)、南方旋毛虫 (*Trichinella nelsoni*)、伪方定毛形线虫 (*Trichinella pseudopsiralis*)、毛圆线虫属 (*Trichostrongylus* spp.)、毛首鞭形线虫 (*Trichuris trichuria*)、班氏吴策线虫 (*Wuchereria bancrofti*)；等足目 (*Isopoda*)，例如鼠妇 (*Armadillidium vulgare*)、栉水虱 (*Oniscus asellus*)、球鼠妇 (*Porcellio scaber*)；综合目 (*Symphyla*)，例如 *Scutigera immaculata*。

[0520] 可由式 (I) 化合物防治的害虫种属的其他实例包括：奥地利金龟子 (*Anisoplia austriaca*)、竹笋夜蛾属 (*Apamea* spp.)、*Austroasca viridigrisea*、稻蓟马 (*Baliothrips bififormis*)、秀丽隐杆线虫 (*Caenorhabditis elegans*)、茎蜂属 (*Cephus* spp.)、甘蓝象鼻虫 (*Ceutorhynchus napi*)、麦茎大跳甲 (*Chaetocnema aridula*)、台湾稻螟 (*Chilo auricilius*)、*Chilo indicus*、稻多丽螟 (*Chilo polychrysus*)、澳大利亚蝗 (*Chortiocetes terminifera*)、*Cnaphalocroci medinalis*、纵卷叶野螟属 (*Cnaphalocrosis* spp.)、纹黄豆粉蝶 (*Colias eurytheme*)、*Collops* spp.、角象白蚁 (*Cornitermes cumulans*)、盲蝽属 (*Creontiades* spp.)、圆头金龟属 (*Cyclocephala* spp.)、玉米叶蝉 (*Dalbulus maidis*)、野蛄蛄 (*Deraceras reticulatum*)、小蔗螟 (*Diatrea saccharalis*)、*Dichelops furcatus*、稻铁甲虫 (*Di cladispa armigera*)；兜虫属 (*Diloboderus* spp.)，如阿根廷兜虫 (*Diloboderus abderus*)；*Edessa* spp.、叶小卷蛾属 (*Epinotia* spp.)、蚁科 (*Formicidae*)、大眼长蝽属 (*Geocoris* spp.)、黄球白蚁 (*Globitermes sulfureus*)、蝼蛄科 (*Gryllotalpidae*)、红足海镰螯螨 (*Halotydeus destructor*)、*Hipnodes bicolor*、水稻菲岛毛眼水蝇 (*Hydrellia philippina*)、马陆属 (*Julus* spp.)、灰飞虱属 (*Laodelphax* spp.)、禾蛛缘椿象 (*Leptocorsia acuta*)、大稻缘椿 (*Leptocorsia oratorius*)、*Liogenys fuscus*、绿蝇属 (*Lucillia* spp.)、*Lyogenys fuscus*、突眼长蝽属 (*Mahanarva* spp.)、玛绢金龟 (*Maladera matrida*)、刷须野螟属 (*Marasmia* spp.)、澳白蚁属 (*Mastotermes* spp.)、水蜡虫 (*Mealybugs*)、*Megascelis* spp.、西印度蔗螟 (*Metamasius hemipterus*)、*Microtheca* spp.、南美毛胫夜蛾 (*Mocis latipes*)、斑色蝽属 (*Murgantia* spp.)、粘虫

(*Mythemina separata*)、不透明新扭白蚁 (*Neocapritermes opacus*)、小体拟新扭白蚁 (*Neocapritermes parvus*)、*Neomegalotomus* spp.、新白蚁属 (*Neotermes* spp.)、稻三点螟 (*Nymphula depunctalis*)、美洲稻绿蝽 (*Oebalus pugnax*)；瘿蚊属 (*Orseolia* spp.)，如稻瘿蚊 (*Orseolia oryzae*)；*Oxycaraenus hyalinipennis*、金翅夜蛾属 (*Plusia* spp.)、福寿螺 (*Pomacea canaliculata*)、原角白蚁属 (*Procornitermes* ssp)、*Procornitermes triacifer*、*Psylloides* spp.、*Rachiplusia* spp.、*Rhodopholus* spp.、*Scaptocoris castanea*、*Scaptocoris* spp.；白禾螟属 (*Scirpophaga* spp.)，如三化螟 (*Scirpophaga incertulas*)、稻白螟 (*Scirpophaga innotata*)；黑蝽属 (*Scotinophara* spp.)，如马来亚稻黑蝽 (*Scotinophara coarctata*)；蛀茎夜蛾属 (*Sesamia* spp.)，如大螟 (*Sesamia inferens*)；白背飞虱 (*Sogaella frucifera*)、热带火蚁 (*Solenopsis geminata*)、*Spissistilus* spp.、条螟 (Stalk borer)、稻蓟马 (*Stenchaetothrips biformis*)、斯氏狭跗线螨 (*Steneotarsonemus spinki*)、棉大卷叶螟 (*Sylepta derogata*)、*Telehin licus*、毛圆线虫属 (*Trichostrongylus* spp.)。

[0521] 式 I 化合物特别可用于防治昆虫，优选吮吸式或刺吸式昆虫，如选自种属缨翅目 (*Thysanoptera*)、双翅目 (*Diptera*) 和半翅目 (*Hemiptera*) 的昆虫，尤其是如下种属：

[0522] 缨翅目：烟褐蓟马 (*Frankliniella fusca*)、苜蓿花蓟马 (*Frankliniella occidentalis*)、东方花蓟马 (*Frankliniella tritici*)、桔硬蓟马 (*Scirtothrips citri*)、稻蓟马 (*Thrips oryzae*)、棕榈蓟马 (*Thrips palmi*) 和烟蓟马 (*Thrips tabaci*)；

[0523] 双翅目 (*Diptera*)，例如埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*)、白纹伊蚊 (*Aedes albopictus*)、刺扰伊蚊 (*Aedes vexans*)、墨西哥果蝇 (*Anastrepha ludens*)、五斑按蚊 (*Anopheles maculipennis*)、灾难按蚊 (*Anopheles crucians*)、白足按蚊 (*Anopheles albimanus*)、冈比亚按蚊 (*Anopheles gambiae*)、费氏按蚊 (*Anopheles freeborni*)、白踝按蚊 (*Anopheles leucosphyrus*)、微小按蚊 (*Anopheles minimus*)、四斑按蚊 (*Anopheles quadrimaculatus*)、红头丽蝇 (*Calliphora vicina*)、地中海实蝇 (*Ceratitis capitata*)、蛆症金蝇 (*Chrysomya bezziana*)、*Chrysomya hominivorax*、腐败金蝇 (*Chrysomya macellaria*)、鹿蝇 (*Chrysops discalis*)、静斑虻 (*Chrysops silacea*)、*Chrysops atlanticus*、螺旋蝇 (*Cochliomyia hominivorax*)、高粱瘿蚊 (*Contarinia sorghicola*)、嗜人瘤蝇蛆 (*Cordylobia anthropophaga*)、狂怒库蠓 (*Culicoides furens*)、尖音库蚊 (*Culex pipiens*)、斑蚊 (*Culex nigripalpus*)、致倦库蚊 (*Culex quinquefasciatus*)、媒斑蚊 (*Culex tarsalis*)、无饰脉毛蚊 (*Culiseta inornata*)、黑尾脉毛蚊 (*Culiseta melanura*)、瓜蝇 (*Dacus cucurbitae*)、油橄榄实蝇 (*Dacus oleae*)、油菜叶瘿蚊 (*Dasineura brassicae*)、葱蝇 (*Delia antique*)、麦地种蝇 (*Delia coarctata*)、灰地种蝇 (*Delia platura*)、甘蓝地种蝇 (*Delia radicum*)、人肤皮蝇 (*Dermatobia hominis*)、小毛厕蝇 (*Fannia canicularis*)、*Geomyza Tripunctata*、马蝇 (*Gasterophilus intestinalis*)、刺舌蝇 (*Glossina morsitans*)、须舌蝇 (*Glossina palpalis*)、*Glossina fuscipes*、胶舌蝇 (*Glossina tachinoides*)、扰血蝇 (*Haematobia irritans*)、*Haplodiplosis equestris*、潜蝇属 (*Hippelates* spp.)、花生田灰地种蝇 (*Hylemyia platura*)、纹皮蝇 (*Hypoderma lineata*)、*Leptoconops torrens*、美洲斑潜蝇 (*Liriomyza sativae*)、美国潜叶蝇 (*Liriomyza trifolii*)、*Lucilia caprina*、铜绿蝇 (*Lucilia cuprina*)、丝光绿蝇

(*Lucilia sericata*)、*Lycoria pectoralis*、*Mansonia titillanus*、麦癭蚊 (*Mayetiola destructor*)、秋家蝇 (*Musca autumnalis*)、家蝇 (*Musca domestica*)、厩腐蝇 (*Muscina stabulans*)、羊狂蝇 (*Oestrus ovis*)、*Opomyza florum*、瑞典麦秆蝇 (*Oscinella frit*)、天仙子泉蝇 (*Pegomya hysocyami*)、葱蝇 (*Phorbia antiqua*)、萝卜蝇 (*Phorbia brassicae*)、麦地种蝇 (*Phorbia coarctata*)、银足白蛉 (*Phlebotomus argentipes*)、哥伦比亚鳞蚊 (*Psorophora columbiae*)、胡萝卜茎蝇 (*Psila rosae*)、*Psorophora discolor*、*Prosimulium mixtum*、樱桃实蝇 (*Rhagoletis cerasi*)、苹果实蝇 (*Rhagoletis pomonella*)、赤尾麻蝇 (*Sarcophaga haemorrhoidalis*)、麻蝇属 (*Sarcophaga* spp.)、带蚋 (*Simulium vittatum*)、厩螫蝇 (*Stomoxys calcitrans*)、牛虻 (*Tabanus bovinus*)、北美黑虻 (*Tabanus atratus*)、红色原虻 (*Tabanus lineola*) 和二毛虫 (*Tabanus similis*)、*Tipula oleracea* 和欧洲大蚊 (*Tipula paludosa*)；

[0524] 半翅目 (Hemiptera)，尤其是蚜虫：*Acyrtosiphon onobrychis*、落叶松球蚜 (*Adelges laricis*)、*Aphidula nasturtii*、甜菜蚜 (*Aphis fabae*)、草莓根蚜 (*Aphis forbesi*)、苹果蚜 (*Aphis pomi*)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)、北美茶藨子蚜 (*Aphis grossulariae*)、希奈德蚜 (*Aphis schneideri*)、卷叶蚜 (*Aphis spiraecola*)、接骨木蚜 (*Aphis sambuci*)、豌豆蚜 (*Acyrtosiphon pisum*)、茄无网蚜 (*Aulacorthum solani*)、飞廉短尾蚜 (*Brachycaudus cardui*)、李短尾蚜 (*Brachycaudus helichrysi*)、桃短尾蚜 (*Brachycaudus persicae*)、*Brachycaudus prunicola*、甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*)、*Capitophorus horni*、*Cerosipha gossypii*、草莓中瘤钉毛蚜 (*Chaetosiphon fragaefolii*)、茶藨子隐瘤蚜 (*Cryptomyzus ribis*)、高加索冷杉椎球蚜 (*Dreyfusia nordmanniana*)、云杉椎球蚜 (*Dreyfusia piceae*)、居根西圆尾蚜 (*Dysaphis radicola*)、*Dysaulacorthum pseudosolani*、车前圆尾蚜 (*Dysaphis plantaginea*)、梨西圆尾蚜 (*Dysaphis pyri*)、蚕豆微叶蝉 (*Empoasca fabae*)、李大尾蚜 (*Hyalopterus pruni*)、茶藨苦菜超瘤蚜 (*Hyperomyzus lactucae*)、麦长管蚜 (*Macrosiphum avenae*)、大戟长管蚜 (*Macrosiphum euphorbiae*)、蔷薇管蚜 (*Macrosiphon rosae*)、巢菜修尾蚜 (*Megoura viciae*)、*Melanaphis pyraeius*、麦无网蚜 (*Metopolophium dirhodum*)、桃蚜 (*Myzodes persicae*)、冬葱蚜 (*Myzus ascalonicus*)、李瘤蚜 (*Myzus cerasi*)、黄药子瘤蚜 (*Myzus varians*)、黑茶藨子衲长管蚜 (*Nasonovia ribis-nigri*)、褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*)、囊柄癭绵蚜 (*Pemphigus bursarius*)、蔗飞虱 (*Perkinsiella saccharicida*)、忽布疣蚜 (*Phorodon humuli*)、苹木虱 (*Psylla mali*)、梨木虱 (*Psylla piri*)、冬葱瘤蛾蚜 (*Rhopalomyzus ascalonicus*)、玉米蚜 (*Rhopalosiphum maidis*)、禾谷缢管蚜 (*Rhopalosiphum padi*)、苹草缢管蚜 (*Rhopalosiphum insertum*)、*Sappaphis mala*、*Sappaphis mali*、麦二叉蚜 (*Schizaphis graminum*)、*Schizoneura lanuginosa*、禾谷网蚜 (*Sitobion avenae*)、白粉虱 (*Trialeturodes vaporariorum*)、桔二叉蚜 (*Toxoptera aurantii*) 和葡萄根瘤蚜 (*Viteus vitifolii*)。

[0525] 半翅目，尤其是绿蝽属 (*Nezara* spp.)，如稻绿蝽 (*Nezara viridula*)。

[0526] 式 I 化合物特别可用于防治半翅目和缨翅目昆虫。

[0527] 式 I 化合物特别可用于防治半翅目昆虫，尤其是绿蝽属 (*Nezara* spp.)，如稻绿蝽 (*Nezara viridula*)。

[0528] 配制剂

[0529] 本发明还涉及包含助剂和至少一种本发明化合物 I 的农业化学组合物。

[0530] 农业化学组合物包含杀害虫有效量的化合物 I。术语“有效量”表示足以防治栽培植物上的害虫或在材料保护中足以防治害虫且不对被处理植物产生显著损害的量的组合物或化合物 I。该量可以在宽范围内变化且取决于各种因素,如待防治的动物害虫品种、被处理的栽培植物或材料、气候条件和所用具体化合物 I。

[0531] 化合物 I、其盐及其 N-氧化物可以转化成常规类型的农业化学组合物,例如溶液、乳液、悬浮液、粉剂、粉末、糊、颗粒、模压品、胶囊及其混合物。组合物类型的实例是悬浮液(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,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。

[0532] 组合物如 Mollet 和 Grubemann, Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001; 或 Knowles, New developments in crop protection product formulation, Agrow Reports DS243, T&F Informa, London, 2005 所述以已知方式制备。

[0533] 合适的助剂是溶剂, 液体载体, 固体载体或填料, 表面活性剂, 分散剂, 乳化剂, 润湿剂, 辅助剂, 加溶剂, 渗透促进剂, 保护性胶体, 粘附剂, 增稠剂, 保湿剂, 驱除剂, 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。

[0534] 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、苄醇、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、 $\gamma$ -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。

[0535] 合适的固体载体或填料是矿土, 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; 多糖粉末, 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。

[0536] 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。该类表面活性剂可以用作乳化剂、分散剂、加溶剂、润湿剂、渗透促进剂、保护性胶体或辅助剂。表面活性剂的实例列于 McCutcheon's, 第 1 卷: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008 (International Ed. 或 North American Ed.) 中。

[0537] 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、 $\alpha$ -烯炔磺酸盐、木素磺酸盐、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。

[0538] 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。N- 取代的脂肪酸酰胺的实例是脂肪酸葡萄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萄糖苷。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。

[0539] 合适的阳离子表面活性剂是季型表面活性剂, 例如具有 1 或 2 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或聚乙烯胺。

[0540] 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化合物 I 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。其他实例由 Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, 第 5 章列出。

[0541] 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。

[0542] 合适的杀菌剂是拌棉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。

[0543] 合适的防冻剂是乙二醇、丙二醇、尿素和甘油。

[0544] 合适的消泡剂是聚硅氧烷、长链醇和脂肪酸盐。

[0545] 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)。

[0546] 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。

[0547] 组合物类型及其制备的实例为:

[0548] i) 水溶性浓缩物 (SL, LS)

[0549] 将 10-60 重量% 本发明化合物 I 和 5-15 重量% 润湿剂 (例如醇烷氧基化物) 溶于加至 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。

[0550] ii) 分散性浓缩物 (DC)

[0551] 将 5-25 重量% 本发明化合物 I 和 1-10 重量% 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。

[0552] iii) 可乳化浓缩物 (EC)

[0553] 将 15-70 重量% 本发明化合物 I 和 5-10 重量% 乳化剂 (例如十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物) 溶于加至 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。

[0554] iv) 乳液 (EW, E0, ES)

[0555] 将 5-40 重量%本发明化合物 I 和 1-10 重量%乳化剂 (例如十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物) 溶于 20-40 重量%水不溶性有机溶剂 (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。

[0556] v) 悬浮液 (SC, OD, FS)

[0557] 在搅拌的球磨机中将 20-60 重量%本发明化合物 I 在加入 2-10 重量%分散剂和润湿剂 (例如木素磺酸钠和醇乙氧基化物)、0.1-2 重量%增稠剂 (例如黄原胶) 和加至 100 重量%的水下粉碎, 得到细碎活性物质悬浮液。用水稀释得到稳定的活性物质悬浮液。对于 FS 类型组合物加入至多 40 重量%粘合剂 (例如聚乙烯醇)。

[0558] vi) 水分散性颗粒和水溶性颗粒 (WG, SG)

[0559] 在加入加至 100 重量%的分散剂和润湿剂 (例如木素磺酸钠和醇乙氧基化物) 下精细研磨 50-80 重量%本发明化合物 I 并借助工业装置 (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。

[0560] vii) 水分散性粉末和水溶性粉末 (WP, SP, WS)

[0561] 将 50-80 重量%本发明化合物 I 在加入 1-5 重量%分散剂 (例如木素磺酸钠)、1-3 重量%润湿剂 (例如醇乙氧基化物) 和加至 100 重量%的固体载体如硅胶下在转子-定子磨机中研磨。用水稀释得到稳定的活性物质分散体或溶液。

[0562] viii) 凝胶 (GW, GF)

[0563] 在搅拌的球磨机中在加入 3-10 重量%分散剂 (例如木素磺酸钠)、1-5 重量%增稠剂 (例如羧甲基纤维素) 和加至 100 重量%的水下粉碎 5-25 重量%本发明化合物 I, 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。

[0564] iv) 微乳液 (ME)

[0565] 将 5-20 重量%本发明化合物 I 加入 5-30 重量%有机溶剂共混物 (例如脂肪酸二甲基酰胺和环己酮)、10-25 重量%表面活性剂共混物 (例如醇乙氧基化物和芳基酚乙氧基化物) 和加至 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。

[0566] iv) 微胶囊 (CS)

[0567] 将包含 5-50 重量%本发明化合物 I、0-40 重量%水不溶性有机溶剂 (例如芳族烃)、2-15 重量%丙烯酸系单体 (例如甲基丙烯酸甲酯、甲基丙烯酸和二-或三丙烯酸酯) 的油相分散到保护性胶体 (例如聚乙烯醇) 的水溶液中。由自由基引发剂引发的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%本发明化合物 I、0-40 重量%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) 的油相分散到保护性胶体 (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。

[0568] ix) 可撒粉粉末 (DP, DS)

[0569] 将 1-10 重量%本发明化合物 I 细碎研磨并与加至 100 重量%的固体载体如细碎高岭土充分混合。

[0570] x) 颗粒 (GR, FG)

[0571] 将 0.5-30 重量%本发明化合物 I 细碎研磨并结合加至 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。

[0572] xi) 超低容量液体 (UL)

[0573] 将 1-50 重量%本发明化合物 I 溶于加至 100 重量%的有机溶剂如芳族烃中。

[0574] 组合物类型 i)-xi) 可以任选包含其他助剂,如 0.1-1 重量%杀菌剂,5-15 重量%防冻剂,0.1-1 重量%消泡剂和 0.1-1 重量%着色剂。

[0575] 农业化学组合物通常包含 0.01-95 重量%,优选 0.1-90 重量%,尤其是 0.5-75 重量%活性物质。活性物质以 90-100%,优选 95-100%的纯度(根据 NMR 光谱)使用。

[0576] 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。施用可以在播种之前或期间进行。化合物 I 及其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繁殖材料的拌种、包衣、造粒、撒粉、浸泡和犁沟内施用方法。优选通过不诱发萌发的方法,例如通过拌种、造粒、包衣和撒粉将化合物 I 或其组合物分别施用于植物繁殖材料上。

[0577] 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,特别优选 0.05-0.9kg/ha,尤其是 0.1-0.75kg/ha。

[0578] 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,通常要求活性物质的量为 0.1-10000g/100kg,优选 1-1000g/100kg,更优选 1-100g/100kg,最优选 5-100g/100kg 植物繁殖材料(优选种子)。

[0579] 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。

[0580] 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)。这些试剂可以以 1:100-100:1,优选 1:10-10:1 的重量比与本发明组合物混合。

[0581] 用户通常将本发明组合物用于前剂量装置、小背包喷雾器、喷雾罐、喷雾飞机或灌溉系统。通常将该农业化学组合物用水、缓冲剂和/或其他助剂配制至所需施用浓度,从而得到即用喷雾液或本发明农业化学组合物。每公顷农业利用区通常施用 20-2000 升,优选 50-400 升即用喷雾液。

[0582] 根据一个实施方案,用户可以自己在喷雾罐中混合本发明组合物的各组分,例如成套包装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助剂。

[0583] 在另一实施方案中,用户可以在喷雾罐中混合本发明组合物的各组分或部分预混的组分,例如包含化合物 I 的组分,并且合适的话可以加入其他助剂和添加剂。

[0584] 在另一实施方案中,用户可以联合(例如在桶混合之后)或依次使用本发明组合物的各组分或部分预混的组分,例如包含化合物 I 的组分。

[0585] 混合物

[0586] 根据本发明的一个实施方案,用户可以自己在喷雾罐中混合本发明组合物的各组分

分,例如成套包装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助剂。

[0587] 在另一实施方案中,用户可以在喷雾罐中混合本发明组合物的各组分或部分预混的组分,例如包含化合物 I 和 / 或选自 M. 1-M. UN. X 或 F. I-F. XII 组的活性物质的组分,并且合适的话可以加入其他助剂和添加剂。

[0588] 在另一实施方案中,用户可以联合(例如在桶混合之后)或依次使用本发明组合物的各组分或部分预混的组分,例如包含化合物 I 和 / 或选自 M. 1-M. UN. X 或 F. I-F. XII 组的活性物质的组分。

[0589] 根据 the Mode of Action Classification of the Insecticide Resistance Action Committee (IRAC) 分类和编号的本发明化合物可以与其一起使用并且可能产生潜在的协同增效效果的农药的下列列举 M 用来说明可能的组合,而不施加任何限制:

[0590] M. 1 选自如下的乙酰胆碱酯酶 (AChE) 抑制剂:

[0591] M. 1A 氨基甲酸酯类,例如涕灭威 (aldicarb)、棉铃威 (alanycarb)、噁虫威 (bendiocarb)、丙硫克百威 (benfuracarb)、丁酮威 (butocarboxim)、丁酮氧威 (butoxycarboxim)、甲萘威 (carbaryl)、虫螨威 (carbofuran)、丁硫克百威 (carbosulfan)、苯虫威 (ethiofencarb)、仲丁威 (fenobucarb)、抗螨脒 (formetanate)、呋线威 (furathiocarb)、异丙威 (isoprocarb)、灭虫威 (methiocarb)、灭多虫 (methomyl)、速灭威 (metolcarb)、甲氧叉威 (oxamyl)、抗蚜威 (pirimicarb)、残杀威 (propoxur)、硫双威 (thiodicarb)、久效威 (thiofanox)、混杀威 (trimethacarb)、XMC、灭杀威 (xylylcarb) 和啉蚜威 (triazamate); 或者

[0592] M. 1B 有机磷酸酯类,例如高灭磷 (acephate)、啉啉磷 (azamethiphos)、乙基谷硫磷 (azinphos-ethyl)、谷硫磷 (azinphosmethyl)、硫线磷 (cadusafos)、氯氧磷 (chlorethoxyfos)、毒虫畏 (chlorfenvinphos)、氯甲硫磷 (chlormephos)、毒死蜱 (chlorpyrifos)、甲基毒死蜱 (chlorpyrifos-methyl)、蝇毒磷 (coumaphos)、杀螟腈 (cyanophos)、甲基内吸磷 (demeton-S-methyl)、二嗪农 (diazinon)、敌敌畏 (dichlorvos/DDVP)、百治磷 (dicrotophos)、乐果 (dimethoate)、甲基毒虫畏 (dimethylvinphos)、乙拌磷 (disulfoton)、EPN、乙硫磷 (ethion)、丙线磷 (ethoprophos)、伐灭磷 (famphur)、苯线磷 (fenamiphos)、杀螟松 (fenitrothion)、倍硫磷 (fenthion)、噁唑硫磷 (fosthiazate)、庚烯磷 (heptenophos)、新烟碱类 (imidacloprid)、异丙胺磷 (isofenphos)、O-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸异丙酯、异噁唑磷 (isoxathion)、马拉硫磷 (malathion)、灭蚜磷 (mecarbam)、甲胺磷 (methamidophos)、杀扑磷 (methidathion)、速灭磷 (mevinphos)、久效磷 (monocrotophos)、二溴磷 (naled)、氧乐果 (omethoate)、砒吸磷 (oxydemeton-methyl)、一六零五 (parathion)、甲基对硫磷 (parathion-methyl)、稻丰散 (phenthoate)、甲拌磷 (phorate)、伏杀磷 (phosalone)、亚胺硫磷 (phosmet)、磷胺 (phosphamidon)、辛硫磷 (phoxim)、虫螨磷 (pirimiphos-methyl)、丙溴磷 (profenofos)、巴胺磷 (propetamphos)、丙硫磷 (prothiofos)、吡啉硫磷 (pyraclofos)、吡啉硫磷 (pyridaphenthion)、喹硫磷 (quinalphos)、治螟磷 (sulfotep)、丁基噁啉磷 (tebupirimfos)、双硫磷 (temephos)、特丁磷 (terbufos)、杀虫威 (tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷 (thiometon)、三唑磷 (triazophos)、敌百虫 (trichlorfon) 和蚜灭磷 (vamidothion);

- [0593] M. 2. GABA 门控氯离子通道拮抗剂, 如
- [0594] M. 2A 环二烯有机氯化物, 例如硫丹 (endosulfan) 或氯丹 (chlordane); 或
- [0595] M. 2B fiproles (苯基吡唑类), 例如乙虫腈 (ethiprole)、锐劲特 (fipronil)、丁
- [0596] 烯氟虫腈 (flufiprole)、pyrafluprole 和 pyriprole;
- [0597] M. 3 选自如下的钠通道调节剂:
- [0598] M. 3A 合成除虫菊酯类, 例如氟丙菊酯 (acrinathrin)、丙烯除虫菊 (allethrin)、右旋丙烯菊酯 (d-cis-trans allethrin)、右旋反式丙烯菊酯 (d-trans allethrin)、氟氯菊酯 (bifenthrin)、生物烯丙菊酯 (bioallethrin)、2-环戊烯基生物烯丙菊酯 (bioallethrin S-cyclopentenyl)、生物苜蓿菊酯 (bioresmethrin)、乙氰菊酯 (cycloprothrin)、氟氯氰菊酯 (cyfluthrin)、高效氟氯氰菊酯 (beta-cyfluthrin)、(RS) 氯氟氰菊酯 (cyhalothrin)、氯氟氰菊酯 (lambda-cyhalothrin)、精高效氯氟氰菊酯 (gamma-cyhalothrin)、氯氰菊酯 (cypermethrin)、甲体氯氰菊酯 (alpha-cypermethrin)、乙体氯氰菊酯 (beta-cypermethrin)、高效反式氯氰菊酯 (theta-cypermethrin)、己体氯氰菊酯 (zeta-cypermethrin)、苯醚氰菊酯 (cyphenothrin)、溴氰菊酯 (deltamethrin)、烯炔菊酯 (empenthrin)、高氰戊菊酯 (esfenvalerate)、醚菊酯 (etofenprox)、甲氰菊酯 (fenpropathrin)、杀灭菊酯 (fenvalerate)、氟氰戊菊酯 (flucythrinate)、氟氯苯菊酯 (flumethrin)、氟胺氰菊酯 (tau-fluvalinate)、溴氟醚菊酯 (halfenprox)、咪炔菊酯 (imiprothrin)、氯氟醚菊酯 (meperfluthrin)、甲氧苄氟菊酯 (metofluthrin)、momfluorothrin、氯菊酯 (permethrin)、苯醚菊酯 (phenothrin)、炔酮菊酯 (prallethrin)、丙氟菊酯 (profluthrin)、除虫菊酯 (pyrethrin (除虫菊 (pyrethrum)))、灭虫菊 (resmethrin)、灭虫硅醚 (silafluofen)、七氟菊酯 (tefluthrin)、四氟醚菊酯 (tetramethylfluthrin)、胺菊酯 (tetramethrin)、四溴菊酯 (tralomethrin) 和四氟菊酯 (transfluthrin); 或
- [0599] M. 3B 钠通道调节剂如 DDT 或甲氧滴滴涕 (methoxychlor);
- [0600] M. 4 选自如下的烟碱型乙酰胆碱受体激动剂 (nAChR):
- [0601] M. 4A 新烟碱类, 例如吡虫啉 (acetamiprid)、噻虫胺 (clothianidin)、呋虫胺 (dinotefuran)、吡虫啉 (imidacloprid)、硝胺烯啶 (nitenpyram)、噻虫啉 (thiacloprid) 和噻虫嗪 (thiamethoxam); 或
- [0602] M. 4A. 1:1-[ (6-氯-3-吡啶基) 甲基 ]-2,3,5,6,7,8-六氢-9-硝基-(5S,8R)-5,8-环氧基-1H-咪唑并 [1,2-a] 氮杂萘; 或
- [0603] M. 4A. 2:1-[ (6-氯-3-吡啶基) 甲基 ]-2-硝基-1-[ (E)-亚戊基氨基 ] 胍; 或
- [0604] M. 4A. 3:1-[ (6-氯-3-吡啶基) 甲基 ]-7-甲基-8-硝基-5-丙氧基-3,5,6,7-四氢-2H-咪唑并 [1,2-a] 吡啶; 或
- [0605] M. 4B 烟碱 (nicotine)。
- [0606] M. 5 选自多杀菌素类别的烟碱型乙酰胆碱受体变构活化剂, 例如艾克敌 105 (spinosad) 或乙基多杀菌素 (spinetoram);
- [0607] M. 6 选自阿维菌素和米尔倍霉素类别的氯离子通道活化剂, 例如齐墩螨素 (abamectin)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐 (emamectin benzoate)、伊维菌素 (ivermectin)、lepimectin 或米尔螨素 (milbemectin);

- [0608] M. 7 保幼激素模拟物, 如
- [0609] M. 7A 保幼激素类似物, 如蒙 512 (hydroprene)、烯虫炔酯 (kinoprene) 和蒙五一五 (methoprene); 或其他如
- [0610] M. 7B 双氧威 (fenoxycarb), 或
- [0611] M. 7C 蚊蝇醚 (pyriproxyfen);
- [0612] M. 8 其他非特异性 (多位点) 抑制剂, 例如
- [0613] M. 8A 烷基卤化物如溴甲烷和其他烷基卤化物, 或
- [0614] M. 8B 氯化苦 (chloropicrin), 或
- [0615] M. 8C 磺酰氟 (sulfuryl fluoride), 或
- [0616] M. 8D 硼砂, 或
- [0617] M. 8E 酒石酸氧锑钾 (tartar emetic);
- [0618] M. 9 选择性同翅目昆虫进食阻断剂, 例如
- [0619] M. 9B 拒嗉酮 (pymetrozine), 或
- [0620] M. 9C 氟啉虫酰胺 (flonicamid);
- [0621] M. 10 螨虫生长抑制剂, 例如
- [0622] M. 10A 四螨嗪 (clofentezine)、噻螨酮 (hexythiazox) 和氟螨嗪 (diflovidazin), 或
- [0623] M. 10B 特苯噁唑 (etoxazole);
- [0624] M. 11 昆虫中肠膜的微生物干扰剂, 例如苏云金芽孢杆菌 (*Bacillus thuringiensis*) 或球形芽孢杆菌 (*Bacillus sphaericus*) 以及它们产生的杀虫蛋白如苏云金芽孢杆菌以色列亚种 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*)、球形芽孢杆菌、苏云金芽孢杆菌鲎泽亚种 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*)、*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki* 和苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种菌株 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*), 或 Bt 作为蛋白: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb 和 Cry34/35Ab1;
- [0625] M. 12 线粒体 ATP 合成酶抑制剂, 如
- [0626] M. 12A 杀螨硫隆 (diafenthiuron), 或
- [0627] M. 12B 有机锡杀螨剂, 如三唑锡 (azocyclotin)、三环锡 (cyhexatin) 或杀螨锡 (fenbutatin oxide), 或
- [0628] M. 12C 克螨特 (propargite), 或
- [0629] M. 12D 三氯杀螨砜 (tetradifon);
- [0630] M. 13 经由质子梯度干扰的氧化磷酸化去偶剂, 例如氟啉虫清 (chlorfenapyr)、二硝酚 (DNOC) 或氟虫胺 (sulfluramid);
- [0631] M. 14 烟碱型乙酰胆碱受体 (nAChR) 通道阻断剂, 例如沙蚕毒素类似物, 如杀虫磺 (bensultap)、杀螟丹 (cartap hydrochloride)、杀虫环 (thiocyclam) 或杀虫双 (thiosultap sodium);
- [0632] M. 15 类型 0 几丁质生物合成抑制剂如苯甲酰脲类, 如双三氟虫脲 (bistrifluron)、定虫隆 (chlorfluazuron)、氟脲杀 (diflubenzuron)、氟螨脲 (flucycloxuron)、氟虫脲 (flufenoxuron)、氟铃脲 (hexaflumuron)、氟丙氧

脲 (lufenuron)、双苯氟脲 (novaluron)、多氟虫酰脲 (noviflumuron)、伏虫隆 (teflubenzuron) 或杀虫隆 (triflumuron) ;

[0633] M. 16 类型 1 几丁质生物合成抑制剂如噻嗪酮 (buprofezin) ;

[0634] M. 17 双翅目昆虫蜕皮干扰剂, 例如灭蝇胺 (cyromazine) ;

[0635] M. 18 蜕皮素受体激动剂如二酰肼类, 例如甲氧苯酰肼 (methoxyfenozide)、双苯酰肼 (tebufenozide)、特丁苯酰肼 (halofenozide)、呋喃虫酰肼 (fufenozide) 或环虫酰肼 (chromafenozide) ;

[0636] M. 19 章鱼胺受体激动剂 (Octopamin receptor agonsit), 例如双甲脒 (amitraz) ;

[0637] M. 20 线粒体配合物 III 电子传输抑制剂, 例如

[0638] M. 20A 灭蚁腠 (hydramethylnon), 或

[0639] M. 20B 灭螨醌 (acequinocyl), 或

[0640] M. 20C 嘧螨酯 (fluacrypyrim) ;

[0641] M. 21 线粒体配合物 III 电子传输抑制剂, 例如

[0642] M. 21A METI 杀螨剂和杀虫剂, 如啞螨醚 (fenazaquin)、啞螨酯 (fenpyroximate)、嘧螨醚 (pyrimidifen)、啞螨酮 (pyridaben)、吡螨胺 (tebufenpyrad) 或啞虫酰胺 (tolfenpyrad), 或

[0643] M. 21B 鱼藤酮 (rotenone) ;

[0644] M. 22 电压依赖性钠通道阻断剂, 例如

[0645] M. 22A 噁二唑虫 (indoxacarb), 或 M. 22B 氰氟虫胺 (metaflumizone), 或 M. 22C 1-[ (E)-[2-(4-氰基苯基)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]氨基]-3-[4-(二氟甲氧基)苯基]脲 ;

[0646] M. 23 乙酰 CoA 羧化酶抑制剂, 如特窗酸 (Tetronic acid) 和特拉姆酸 (Tetramic acid) 衍生物, 例如螺螨酯 (spirodiclofen)、螺甲螨酯 (spiromesifen)、螺虫乙酯 (spirotetramat) ;

[0647] M. 24 线粒体配合物 IV 电子传输抑制剂, 例如

[0648] M. 24A 膦类如磷化铝、磷化钙、膦或磷化锌, 或

[0649] M. 24B 氰化物。

[0650] M. 25 线粒体配合物 II 电子传输抑制剂, 如  $\beta$ -酮腈衍生物, 例如腈吡螨酯 (cyenopyrafen) 或丁氟螨酯 (cyflumetofen) ;

[0651] M. 28 选自二酰胺类的鱼尼汀 (Ryanodine) 受体调节剂, 例如氟虫酰胺 (flubendiamide), 氯虫酰胺 (chlorantraniliprole) (**rynaxypyr**<sup>®</sup>)、氰虫酰胺 (cyantraniliprole) (**cyazypyr**<sup>®</sup>), 或邻苯二甲酰胺化合物

[0652] M. 28.1 : (R)-3-氯-N1-[2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基]-N2-(1-甲基-2-甲基磺酰基乙基)邻苯二甲酰胺, 和

[0653] M. 28.2 : (S)-3-氯-N1-[2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基]-N2-(1-甲基-2-甲基磺酰基乙基)邻苯二甲酰胺, 或化合物

[0654] M. 28.3 : 3-溴-N-[2-溴-4-氯-6-[(1-环丙基乙基)氨基甲酰基]苯

基]-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-甲酰胺(建议的 ISO 名:cyclaniliprole),或化合物

[0655] M. 28. 4 :2-[3,5-二溴-2-([3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基)氨基)苯甲酰基]-1,2-二甲基胍甲酸甲酯;或选自 M. 28. 5a)-M. 28. 5l) 的化合物:

[0656] M. 28. 5a)N-[4,6-二氯-2-[(二乙基- $\lambda$ -4-亚硫烷基(sulfanylidene))氨基甲酰基]苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-三氟甲基吡啶-3-甲酰胺;

[0657] M. 28. 5b)N-[4-氯-2-[(二乙基- $\lambda$ -4-亚硫烷基)氨基甲酰基]-6-甲基苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-三氟甲基吡啶-3-甲酰胺;

[0658] M. 28. 5c)N-[4-氯-2-[(二-2-丙基- $\lambda$ -4-亚硫烷基)氨基甲酰基]-6-甲基苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-三氟甲基吡啶-3-甲酰胺;

[0659] M. 28. 5d)N-[4,6-二氯-2-[(二-2-丙基- $\lambda$ -4-亚硫烷基)氨基甲酰基]苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-三氟甲基吡啶-3-甲酰胺;

[0660] M. 28. 5e)N-[4,6-二氯-2-[(二乙基- $\lambda$ -4-亚硫烷基)氨基甲酰基]-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-二氟甲基吡啶-3-甲酰胺;

[0661] M. 28. 5f)N-[4,6-二溴-2-[(二-2-丙基- $\lambda$ -4-亚硫烷基)氨基甲酰基]-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-三氟甲基吡啶-3-甲酰胺;

[0662] M. 28. 5g)N-[4-氯-2-[(二-2-丙基- $\lambda$ -4-亚硫烷基)氨基甲酰基]-6-氰基苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-三氟甲基吡啶-3-甲酰胺;

[0663] M. 28. 5h)N-[4,6-二溴-2-[(二乙基- $\lambda$ -4-亚硫烷基)氨基甲酰基]-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-三氟甲基吡啶-3-甲酰胺;

[0664] M. 28. 5i)N-[2-(5-氨基-1,3,4-噁二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-5-溴-2-(3-氯-2-吡啶基)吡啶-3-甲酰胺;

[0665] M. 28. 5j)5-氯-2-(3-氯-2-吡啶基)-N-[2,4-二氯-6-[(1-氰基-1-甲基乙基)氨基甲酰基]苯基]吡啶-3-甲酰胺;

[0666] M. 28. 5k)5-溴-N-[2,4-二氯-6-(甲基氨基甲酰基)苯基]-2-(3,5-二氯-2-吡啶基)吡啶-3-甲酰胺;

[0667] M. 28. 5l)N-[2-(叔丁基氨基甲酰基)-4-氯-6-甲基苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(氟甲氧基)吡啶-3-甲酰胺;或选自如下的化合物:

[0668] M. 28. 6 :N<sub>2</sub>-(1-氰基-1-甲基乙基)-N<sub>1</sub>-(2,4-二甲基苯基)-3-碘-邻苯二甲酰胺;或

[0669] M. 28. 7 :3-氯-N<sub>2</sub>-(1-氰基-1-甲基乙基)-N<sub>1</sub>-(2,4-二甲基苯基)邻苯二甲酰胺;

[0670] M. UN. X 未知或不确定作用模式的农药活性化合物,包括 afidopyropen、艾扎丁(azadirachtin)、amidoflumet、苯螨特(benzoximate)、联苯胍酯(bifenazate)、溴螨酯(bromopropylate)、灭螨猛(chinomethionat)、冰晶石(cryolite)、开乐散(dicofol)、噁虫胺(flufenimer)、flometoquin、fluensulfone、flupyradifurone、增效醚(piperonyl butoxide)、啉虫丙醚(pyridalyl)、pyrifluquinazon、sulfoxaflo、pyflubumide 或如下化合物:

[0671] M. UN. X. 1 :4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氢异噁唑-3-基]-2-甲

基-N-[(2,2,2-三氟乙基氨基甲酰基)甲基]苯甲酰胺,或化合物

[0672] M. UN. X. 2 :4-[5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[2-氧代-2-(2,2,2-三氟乙基氨基)乙基]萘-1-甲酰胺,或化合物

[0673] M. UN. X. 3 :11-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-12-羟基-1,4-二氧杂-9-氮杂二螺[4.2.4.2]十四碳-11-烯-10-酮,或化合物

[0674] M. UN. X. 4 :3-(4'-氟-2,4-二甲基联苯-3-基)-4-羟基-8-氧杂-1-氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮,或化合物

[0675] M. UN. X. 5 :1-[2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亚磺酰基]苯基]-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺或基于坚强芽孢杆菌 (*Bacillus firmus*) 的活性物 (Votivo, I-1582);或

[0676] M. UN. X. 6 :选自如下的化合物:

[0677] M. UN. X. 6a : (E/Z)-N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-吡啶亚基]-2,2,2-三氟乙酰胺;

[0678] M. UN. X. 6b : (E/Z)-N-[1-[(6-氯-5-氟-3-吡啶基)甲基]-2-吡啶亚基]-2,2,2-三氟乙酰胺;

[0679] M. UN. X. 6c : (E/Z)-2,2,2-三氟-N-[1-[(6-氟-3-吡啶基)甲基]-2-吡啶亚基]乙酰胺;

[0680] M. UN. X. 6d : (E/Z)-N-[1-[(6-溴-3-吡啶基)甲基]-2-吡啶亚基]-2,2,2-三氟乙酰胺;

[0681] M. UN. X. 6e : (E/Z)-N-[1-[1-(6-氯-3-吡啶基)乙基]-2-吡啶亚基]-2,2,2-三氟乙酰胺;

[0682] M. UN. X. 6f : (E/Z)-N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-吡啶亚基]-2,2-二氟乙酰胺;

[0683] M. UN. X. 6g : (E/Z)-2-氯-N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-吡啶亚基]-2,2-二氟乙酰胺;

[0684] M. UN. X. 6h : (E/Z)-N-[1-[(2-氯嘧啶-5-基)甲基]-2-吡啶亚基]-2,2,2-三氟乙酰胺和

[0685] M. UN. X. 6i : (E/Z)-N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-吡啶亚基]-2,2,3,3,3-五氟丙酰胺);或化合物

[0686] M. UN. X. 7 :3-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-4-氧代-1-(嘧啶-5-基甲基)吡啶并[1,2-a]嘧啶-1-~~噻~~-2-酚盐 (olate);或

[0687] M. UN. X. 8 :8-氯-N-[2-氯-5-甲氧基苯基]磺酰基]-6-三氟甲基)-咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺;或

[0688] M. UN. X. 9 :4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(1-噁噻烷-3-基)苯甲酰胺;或

[0689] M. UN. X. 10 :5-[3-[2,6-二氯-4-(3,3-二氯烯丙氧基)苯氧基]丙氧基]-1H-吡唑。

[0690] 上面所列M组市售化合物尤其可以在 The Pesticide Manual, 第15版,



C. D. S. Tomlin, British Crop Protection Council (2011) 中找到。

[0691] 喹啉衍生物 flometoquin 示于 W02006/013896 中。氨基呋喃酮化合物 flupyradifurone 由 W02007/115644 已知。磺酰亚胺化合物 sulfoxaflor 由 W02007/149134 已知。拟除虫菊酯 momfluorothrin 由 US6908945 已知。吡唑类杀螨剂 pyflubumide 由 W02007/020986 已知。异噁唑啉类化合物 M. UN. X. 1 描述于 W02005/085216 中, M. UN. X. 2 描述于 W02009/002809 和 W02011/149749 中, 且异噁唑啉类 M. UN. X. 9 描述于 W02013/050317 中。Pyripyropene 衍生物 afidopyropen 描述于 W02006/129714 中。螺缩酮取代的环状酮-烯醇衍生物 M. UN. X. 3 由 W02006/089633 已知, 且联苯基取代的螺环酮-烯醇衍生物 M. UN. X. 4 由 W02008/067911 已知。最后, 三唑基苯基硫化物如 M. UN. X. 5 描述于 W02006/043635 中且基于坚强芽孢杆菌的生物控制剂描述于 W02009/124707 中。新烟碱类 4A. 1 由 W020120/069266 和 W02011/06946 已知, M. 4. A. 2 由 W02013/003977 已知, M. 4. A. 3 由 W02010/069266 已知。氰氟虫胺类似物 M. 22C 描述于 CN10171577 中。邻苯二甲酰胺类 M. 28. 1 和 M. 28. 2 均由 W02007/101540 已知。邻氨基苯甲酰胺 M. 28. 3 描述于 W02005/077943 中。酰肼化合物 M. 28. 4 描述于 W02007/043677 中。邻氨基苯甲酰胺 M. 28. 5a) -M. 28. 5h) 可以如 W02007/006670、W02013/024009 和 W02013/024010 所述那样制备, 邻氨基苯甲酰胺 M. 28. 5i) 描述于 W02011/085575 中, M. 28. 5j) 描述于 W02008/134969 中, M. 28. 5k) 描述于 US2011/046186 中且 M. 28. 5l) 描述于 W02012/034403 中。二酰胺化合物 M. 28. 6 和 M. 28. 7 可以在 CN102613183 中找到。列于 M. UN. X. 6 中的化合物 M. UN. X. 6a) -M. UN. X. 6i) 描述于 W02012/029672 中。介离子拮抗化合物 M. UN. X. 7 描述于 W02012/092115 中, 杀线虫剂 M. UN. X. 8 描述于 W02013/055584 中且啉虫丙醚型类似物 M. UN. X. 10 描述于 W02010/060379 中。

[0692] 本发明化合物可以与其联合使用的杀真菌活性物质的下列列举用于说明可能的组合, 但不限制它们:

[0693] F. I) 呼吸抑制剂

[0694] F. I-1) Q<sub>o</sub> 位点的配合物 III 抑制剂 (例如嗜球果伞素类)

[0695] 嗜球果伞素类: 腈嘧菌酯 (azoxystrobin)、醚菌胺 (dimoxystrobin)、烯炔菌酯 (enestroburin)、氟嘧菌酯 (fluoxastrobin)、亚胺菌 (kresoxim-methyl)、叉氨苯酰胺 (metaminostrobin)、肟醚菌胺 (orysastrobin)、啉氧菌酯 (picoxystrobin)、唑菌胺酯 (pyraclostrobin)、pyrametostrobin、唑菌酯 (pyraoxystrobin)、pyribencarb、肟菌酯 (trifloxystrobin)、(2-氯-5-[1-(3-甲基苄氧亚氨基)乙基]苄基)氨基甲酸甲酯和 2-(2-(3-(2,6-二氯苯基)-1-甲基亚烯丙基氨基氧甲基)苯基)-2-甲氧亚氨基-N-甲基乙酰胺;

[0696] 噁唑烷二酮类和咪唑啉酮类: 噁唑酮菌 (famoxadone)、咪唑菌酮 (fenamidone);

[0697] F. I-2) 配合物 II 抑制剂 (例如羧酰胺类)

[0698] 羧酰苯胺类: 麦锈灵 (benodanil)、bixafen、啉酰菌胺 (boscalid)、萎锈灵 (carboxin)、呋菌胺 (fenfuram)、环酰菌胺 (fenhexamid)、氟吡菌酰胺 (fluopyram)、氟酰胺 (flutolanil)、呋吡唑灵 (furametpyr)、isopyrazam、异噁菌胺 (isotianil)、丙氧灭锈胺 (mepronil)、氧化萎锈灵 (oxycarboxin)、penflufen、吡噁菌胺 (penthioopyrad)、

sedaxane、叶枯酞 (tecloftalam)、溴氟唑菌 (thifluzamide)、噻酰菌胺 (tiadinil)、2-氨基-4-甲基噻唑-5-甲酰苯胺、N-(3',4',5'-三氟联苯-2-基)-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、N-(4'-三氟甲硫基联苯-2-基)-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺和N-(2-(1,3,3-三甲基丁基)苯基)-1,3-二甲基-5-氟-1H-吡唑-4-甲酰胺;

[0699] F. I-3) Qi 位点的配合物 III 抑制剂: 氰霜唑 (cyazofamid)、amisulbrom;

[0700] F. I-4) 其他呼吸抑制剂 (配合物 I, 去偶剂)

[0701] 二氟林 (diflumetorim); 四氯硝基苯 (tecnazen); 噻菌脞 (ferimzone); ametoctradin; 硅噻菌胺 (silthiofam);

[0702] 硝基苯基衍生物: 乐杀螨 (binapacryl)、敌螨通 (dinobuton)、敌螨普 (dinocap)、氟啶胺 (fluazinam)、异丙消 (nitrthal-isopropyl);

[0703] 有机金属化合物: 三苯锡基盐, 例如薯瘟锡 (fentin-acetate)、三苯锡氯 (fentin chloride) 或毒菌锡 (fentin hydroxide);

[0704] F. II) 甾醇生物合成抑制剂 (SBI 杀真菌剂)

[0705] F. II-1) C14 脱甲基酶抑制剂 (DMI 杀真菌剂, 例如三唑类、咪唑类)

[0706] 三唑类: 戊环唑 (azaconazole)、双苯三唑醇 (bitertanol)、糠菌唑 (bromuconazole)、环唑醇 (cyproconazole)、噁醚唑 (difenoconazole)、烯唑醇 (diniconazole)、烯唑醇 M (diniconazole-M)、氧唑菌 (epoxiconazole)、腈苯唑 (fenbuconazole)、喹唑菌酮 (fluquinconazole)、氟硅唑 (flusilazole)、粉唑醇 (flutriafol)、己唑醇 (hexaconazole)、酰胺唑 (imibenconazole)、环戊唑醇 (ipconazole)、环戊唑菌 (metconazole)、腈菌唑 (myclobutanil)、多效唑 (paclobutrazole)、戊菌唑 (penconazole)、丙环唑 (propiconazole)、丙硫菌唑 (prothioconazole)、硅氟唑 (simeconazole)、戊唑醇 (tebuconazole)、氟醚唑 (tetraconazole)、三唑酮 (triadimefon)、唑菌醇 (triadimenol)、戊叉唑菌 (triticonazole)、烯效唑 (uniconazole);

[0707] 咪唑类: 抑霉唑 (imazalil)、稻瘟酯 (pefurazoate)、oxpoconazole、丙氯灵 (prochloraz)、氟菌唑 (triflumizole);

[0708] 嘧啶类、吡啶类和哌嗪类: 异嘧菌醇 (fenarimol)、氟苯嘧啶醇 (nuarimol)、啉斑肟 (pyrifenox)、嗪氨灵 (triforine);

[0709] F. II-2)  $\delta$  14-还原酶抑制剂 (胺类, 例如吗啉类、哌啶类)

[0710] 吗啉类: 4-十二烷基-2,6-二甲基吗啉 (aldimorph)、吗菌灵 (dodemorph)、吗菌灵乙酸酯 (dodemorph-acetate)、丁苯吗啉 (fenpropimorph)、克啉菌 (tridemorph);

[0711] 哌啶类: 苯锈啶 (fenpropidin)、粉病灵 (piperalin);

[0712] 螺缩酮胺类: 螺噁茂胺 (spiroxamine);

[0713] F. II-3) 3-酮基还原酶抑制剂: 环酰菌胺 (fenhexamid);

[0714] F. III) 核酸合成抑制剂

[0715] F. III-1) RNA, DNA 合成

[0716] 苯基酰胺类或酰基氨基酸类杀真菌剂: 苯霜灵 (benalaxyl)、精苯霜灵 (benalaxyl-M)、kiralaxyl、甲霜灵 (metalaxyl)、精甲霜灵 (metalaxyl-M) (mefenoxam)、

- 甲呋酰胺 (ofurace)、噁霜灵 (oxadixyl); 异噁唑类和异噁唑啉酮类: 土菌消 (hymexazole)、异噁菌酮 (octhilinone);
- [0717] F. III-2) DNA 拓扑异构酶抑制剂: 恶唑酸 (oxolinic acid);
- [0718] F. III-3) 核苷酸代谢 (例如腺苷脱氨酶)
- [0719] 羟基 (2-氨基) 嘧啶类: 磺嘧菌灵 (bupirimate);
- [0720] F. IV) 细胞分裂或细胞骨架抑制剂
- [0721] F. IV-1) 微管蛋白抑制剂, 如苯并咪唑类和托布津类 (thiophanate): 苯菌灵 (benomyl)、多菌灵 (carbendazim)、麦穗宁 (fuberidazole)、涕必灵 (thiabendazole)、甲基托布津 (thiophanate-methyl); 三唑并嘧啶类: 5-氯-7-(4-甲基哌啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)-[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶;
- [0722] F. IV-2) 其他细胞分裂抑制剂
- [0723] 苯甲酰胺类和苯基乙酰胺类: 乙霉威 (diethofencarb)、噁唑菌胺 (ethaboxam)、戊菌隆 (pencycuron)、氟吡菌胺 (fluopicolide)、苯酰菌胺 (zoxamide);
- [0724] F. IV-3) 肌动蛋白抑制剂: 二苯甲酮类: 苯菌酮 (metrafenone);
- [0725] F. V) 氨基酸和蛋白质合成抑制剂
- [0726] F. V-1) 蛋氨酸合成抑制剂 (苯胺基嘧啶类)
- [0727] 苯胺基嘧啶类: 环丙嘧啶 (cyprodinil)、嘧菌胺 (mepanipyrim)、氯定 (nitrapyrin)、二甲嘧菌胺 (pyrimethanil);
- [0728] F. V-2) 蛋白质合成抑制剂 (苯胺基嘧啶类)
- [0729] 抗生素类: 灭瘟素 (blasticidin-S)、春雷素 (kasugamycin)、水合春雷素 (kasugamycin hydrochloride-hydrate)、米多霉素 (mildiomycin)、链霉素 (streptomycin)、土霉素 (oxytetracyclin)、多氧霉素 (polyoxine)、井冈霉素 (validamycin A);
- [0730] F. VI) 信号转导抑制剂
- [0731] F. VI-1) MAP/ 组氨酸蛋白激酶抑制剂 (例如苯胺基嘧啶类)
- [0732] 二羧酰亚胺类: 氟菌安 (fluoroimid)、异丙定 (iprodone)、杀菌利 (procymidone)、烯菌酮 (vinclozolin);
- [0733] 苯基吡咯类: 拌种咯 (fenpiclonil)、氟噁菌 (fludioxonil);
- [0734] F. VI-2) G 蛋白抑制剂: 喹啉类: 喹氧灵 (quinoxifen);
- [0735] F. VII) 类脂和膜合成抑制剂
- [0736] F. VII-1) 磷脂生物合成抑制剂
- [0737] 有机磷化合物: 克瘟散 (edifenphos)、异稻瘟净 (iprobenfos)、定菌磷 (pyrazophos);
- [0738] 二硫戊环类: 稻瘟灵 (isoprothiolane);
- [0739] F. VII-2) 类脂过氧化
- [0740] 芳族炔类: 氯硝胺 (dicloran)、五氯硝基苯 (quintozene)、四氯硝基苯 (tecnazene)、甲基立枯磷 (tolclofos-methyl)、联苯、地茂散 (chloroneb)、氯唑灵 (etridiazole);
- [0741] F. VII-3) 羧酸酰胺 (CAA 杀真菌剂)

- [0742] 肉桂酸或扁桃酸酰胺：烯酰吗啉 (dimethomorph)、氟吗啉 (flumorph)、双炔酰菌胺 (mandipropamid)、丁吡吗啉 (pyrimorph)；
- [0743] 缬氨酰胺氨基甲酸酯类：苯噻菌胺 (benthiavalicarb)、异丙菌胺 (iprovalicarb)、pyribencarb、valifenalate 和 N-(1-(1-(4- 氰基苯基) 乙磺酰基) 丁-2-基) 氨基甲酸 4- 氟苯基酯；
- [0744] F. VII-4) 影响细胞膜渗透性的化合物和脂肪酸；
- [0745] 氨基甲酸酯类：百维灵 (propamocarb)、霜霉威盐酸盐 (propamocarb-hydrochlorid)；
- [0746] F. VIII) 具有多位点作用的抑制剂
- [0747] F. VIII-1) 无机活性物质：波尔多液 (Bordeaux 混合物)、醋酸铜、氢氧化铜、王铜 (copper oxychloride)、碱式硫酸铜、硫；
- [0748] F. VIII-2) 硫代-和二硫代氨基甲酸酯类：福美铁 (ferbam)、代森锰锌 (mancozeb)、代森锰 (maneb)、威百亩 (metam)、磺菌威 (methasulphocarb)、代森联 (metiram)、甲基代森锌 (propineb)、福美双 (thiram)、代森锌 (zineb)、福美锌 (ziram)；
- [0749] F. VIII-3) 有机氯化物 (例如邻苯二甲酰亚胺类、硫酰胺类、氯代腈类)：敌菌灵 (anilazine)、百菌清 (chlorothalonil)、敌菌丹 (captafol)、克菌丹 (captan)、灭菌丹 (folpet)、抑菌灵 (dichlofluanid)、双氯酚 (dichlorophen)、磺菌胺 (flusulfamide)、六氯苯 (hexachlorobenzene)、五氯酚 (pentachlorophenole) 及其盐、四氯苯酞 (phthalide)、对甲抑菌灵 (tolylfluanid)、N-(4- 氯-2- 硝基苯基)-N- 乙基-4- 甲基苯磺酰胺；
- [0750] F. VIII-4) 胍类及其他：胍、多果定 (dodine)、多果定游离碱、双胍盐 (guazatine)、双胍辛胺 (guazatine-acetate)、双胍辛醋酸盐 (iminocadine)、双胍辛胺三乙酸盐 (iminocadine-triacetate)、双八胍盐 (iminocadine-tris(albesilate))；
- [0751] F. VIII-5) 葱醌类：二噻农 (dithianon)；
- [0752] F. IX) 细胞壁合成抑制剂
- [0753] F. IX-1) 葡聚糖合成抑制剂：井冈霉素 (validamycin)、多氧霉素 (polyoxin B)；
- [0754] F. IX-2) 黑素合成抑制剂：咯嗪酮 (pyroquilon)、三环唑 (tricyclazole)、氯环丙酰胺 (carpropamide)、双氯氰菌胺 (dicyclomet)、氰菌胺 (fenoxanil)；
- [0755] F. X) 植物防御诱发剂
- [0756] F. X-1) 水杨酸途径：噻二唑素 (acibenzolar-S-methyl)；
- [0757] F. X-2) 其他：噻菌灵 (probenazole)、异噻菌胺 (isotianil)、噻酰菌胺 (tiadinil)、调环酸钙 (prohexadione-calcium)；
- [0758] 膦酸酯类：藻菌磷 (fosetyl)、乙磷铝 (fosetyl-aluminum)、亚磷酸及其盐；
- [0759] F. XI) 未知作用模式；
- [0760] 拌棉醇 (bronopol)、灭螨蚧 (chinomethionat)、环氟菌胺 (cyflufenamid)、清菌脲 (cymoxanil)、棉隆 (dazomet)、咪菌威 (debacarb)、哒菌清 (diclomezine)、野燕枯 (difenzoquat)、野燕枯甲基硫酸酯 (difenzoquat-methylsulfate)、二苯胺、氟联苯菌 (flumetover)、磺菌胺、flutianil、磺菌威 (methasulfocarb)、啞啉铜 (oxin-copper)、丙氧啞啉 (proquinazid)、tebufloquin、叶枯酞、啞菌啞 (triazoxide)、2- 丁氧基-6- 碘-3- 丙基苯并吡喃-4- 酮、N-( 环丙基甲氧亚氨基-(6- 二氟甲氧基-2, 3- 二氟苯

基)甲基)-2-苯基乙酰胺、N'-(4-(4-氯-3-三氟甲基苯氧基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、N'-(4-(4-氟-3-三氟甲基苯氧基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、N'-(2-甲基-5-三氟甲基-4-(3-三甲基硅烷基丙氧基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、N'-(5-二氟甲基-2-甲基-4-(3-三甲基硅烷基丙氧基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、2-{1-[2-(5-甲基-3-三氟甲基吡唑-1-基)乙酰基]哌啶-4-基}噻唑-4-甲酸甲基-(1,2,3,4-四氢萘-1-基)酰胺、2-{1-[2-(5-甲基-3-三氟甲基吡唑-1-基)乙酰基]哌啶-4-基}噻唑-4-甲酸甲基-(R)-1,2,3,4-四氢萘-1-基酰胺、甲氧基乙酸 6-叔丁基-8-氟-2,3-二甲基喹啉-4-基酯、N-甲基-2-{1-[(5-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-1-基)乙酰基]哌啶-4-基}-N-[(1R)-1,2,3,4-四氢萘-1-基]-4-噻唑甲酰胺、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基异噁唑烷-3-基]吡啶、3-[5-(4-甲基苯基)-2,3-二甲基异噁唑烷-3-基]吡啶、5-氨基-2-异丙基-3-氧代-4-邻甲苯基-2,3-二氢吡唑-1-硫代甲酸 S-烯丙基酯、N-(6-甲氧基吡啶-3-基)环丙烷甲酰胺、5-氯-1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-2-甲基-1H-苯并咪唑、2-(4-氯苯基)-N-[4-(3,4-二甲氧基苯基)异噁唑-5-基]-2-丙-2-炔基氧基乙酰胺；

[0761] F. XI) 生长调节剂

[0762] 脱落酸 (abscisic acid)、先甲草胺 (amidochlor)、嘧啶醇 (ancymidol)、6-苄基氨基嘌呤、油菜素内酯 (brassinolide)、地乐胺 (butralin)、矮壮素阳离子 (chlormequat) (氯化矮壮素 (chlormequat chloride))、胆碱盐酸盐 (choline chloride)、环丙酸酰胺 (cyclanilide)、丁酰肼 (daminozide)、敌草克 (dikegulac)、噻节因 (dimethipin)、2,6-二甲基吡啶 (2,6-dimethylpuridine)、乙烯利 (ethephon)、氟节胺 (flumetralin)、调啉醇 (flurprimidol)、达草氟 (fluthiacet)、调吡脲 (forchlorfenuron)、赤霉酸 (gibberellic acid)、抗倒胺 (inabenfide)、吡啶-3-乙酸、抑芽丹 (maleic hydrazide)、氟草磺 (mefluidide)、助壮素 (mepiquat) (氯化助壮素 (mepiquat chloride))、萘乙酸、N-6-苄基腺嘌呤、多效唑、调环酸 (prohexadione) (调环酸钙)、茉莉酸诱导体 (prohydrojasmon)、赛二唑素 (thidiazuron)、抑芽唑 (triapenthenol)、三硫代磷酸三丁酯、2,3,5-三碘苯甲酸、抗倒酯 (trinexapac-ethyl) 和烯效唑；

[0763] F. XII) 生物控制剂

[0764] 抗真菌的生物控制剂：具有 NRRL No.B-21661 的枯草芽孢杆菌 (*Bacillus subtilis*) 菌株 (例如来自 AgraQuest, Inc., USA. 的 **RHAPSODY®**, **SERENADE®** MAX 和 **SERENADE®** ASO), 具有 NRRL No.B-30087 的短小芽孢杆菌 (*Bacillus pumilus*) 菌株 (例如来自 AgraQuest, Inc., USA 的 **SONATA®** 和 **BALLAD®** Plus), 奥德曼细基格孢 (*Ulocladium oudemansii*) (例如来自新西兰 BotriZen Ltd. 的产品 BOTRY-ZEN), 壳聚糖 (例如来自新西兰 BotriZen Ltd. 的 ARMOUR-ZEN)。

[0765] 应用

[0766] 可以通过本领域已知的任何施用方法使动物害虫,即昆虫、蜘蛛和线虫,植物、土壤或其中植物生长的水体与本发明式 I 化合物或含有它们的组合物接触。这里的“接触”包

括直接接触（将化合物 / 组合物直接施用于动物害虫或植物上，通常施用于植物的叶面、茎或根）和间接接触（将化合物 / 组合物施用于动物害虫或植物的场所）二者。

[0767] 式 I 化合物或包含它们的杀虫组合物可以通过使植物 / 作物与杀虫有效量的式 I 化合物接触而用于保护生长的植物和作物以防动物害虫，尤其是昆虫、螨科或蜘蛛侵袭或侵染。术语“作物”指生长和收获的作物二者。

[0768] 本发明化合物和包含它们的组合物对于在各种栽培植物如禾谷类、根系作物、油料作物、蔬菜、香料、观赏植物，例如硬粒小麦和其他小麦、大麦、燕麦、黑麦、玉米（青饲玉米和甜玉蜀黍 / 甜玉米以及大田玉米）、大豆、油料作物、十字花科植物、棉花、向日葵、香蕉、稻、油籽油菜、芜菁油菜、糖用甜菜、饲料甜菜、茄子、土豆、禾草、草坪、草皮、牧草、西红柿、韭葱、南瓜 / 笋瓜、卷心菜、刺茎莴苣、胡椒、黄瓜、甜瓜、芸苔属 (Brassica)、甜瓜、菜豆、豌豆、大蒜、洋葱、胡萝卜、块茎植物如土豆、甘蔗、烟草、葡萄、矮牵牛、天竺葵 / 香叶天竺葵、三色堇和凤仙花的种子中防治大量昆虫特别重要。

[0769] 本发明化合物通过用杀虫有效量的活性化合物处理昆虫或植物、植物繁殖材料如种子、土壤、表面、材料或待防止昆虫侵袭的空间而直接或以组合物形式使用。施用可以在植物、植物繁殖材料如种子、土壤、表面、材料或空间被昆虫侵染之前和之后进行。

[0770] 本发明还包括一种防治动物害虫的方法，包括使动物害虫、其栖息地、繁殖地、食物供应源、栽培植物、种子、土壤、区域、材料或其中动物害虫生长或可能生长的环境或要防治动物侵袭或侵染的材料、植物、种子、土壤、表面或空间与杀虫有效量的至少一种式 I 化合物的混合物接触。

[0771] 此外，动物害虫可以通过使目标害虫、其食物供应源、栖息地、繁殖地或其场所与杀虫有效量的式 I 化合物接触而防治。这里的施用可以在场所、生长作物或收获作物被害虫侵染之前或之后进行。

[0772] 本发明化合物还可以预防性地施用于预期出现害虫的地方。

[0773] 式 I 化合物还可以通过使植物与杀虫有效量的式 I 化合物接触而用于保护生长的植物以防害虫侵袭或侵染。这里的“接触”包括直接接触（将化合物 / 组合物直接施用于害虫和 / 或植物上，通常施用于植物的叶面、茎或根）和间接接触（将化合物 / 组合物施用于害虫或植物的场所）二者。

[0774] “场所”是指栖息地、繁殖地、植物、种子、土壤、区域、材料或其中害虫或寄生虫生长或可能生长的环境。

[0775] 术语“植物繁殖材料”应理解为表示植物的所有繁殖部分如种子，以及可以用于繁殖植物的无性植物材料如插条和块茎（例如土豆）。这包括种子、根、果实、块茎、球茎、地下茎、嫩枝、芽和其他植物部分。还可包括在萌发后或出苗后由土壤移植的秧苗和幼苗。这些植物繁殖材料可以在种植或移栽之时或之前用植物保护化合物预防性处理。

[0776] 术语“栽培植物”应理解为包括已经通过育种、诱变或基因工程修饰的植物。基因修饰植物是其基因材料通过使用在自然条件下不易通过杂交、突变或自然重组得到的重组 DNA 技术修饰的植物。通常将一个或多个基因整合到基因修饰植物的基因材料中以改善植物的某些性能。这类基因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如异戊二烯化、乙酰化或法呢基化结构部分或 PEG 结构部分（例如如 Biotechnol Prog. 2001 年 7 月至 8 月 ;17(4) :720-8, Protein Eng Des Sel. 2004

年 1 月 ;17(1) :57-66, Nat Protoc. 2007 ;2(5) :1225-35, Curr Opin Chem Biol. 2006 年 10 月 ;10(5) :487-91, 2006 年 8 月 28 日 Epub, Biomaterials. 2001 年 3 月 ;22(5) :405-17, Bioconjug Chem. 2005 年 1-2 月 ;16(1) :113-21 所公开)。

[0777] 术语“栽培植物”应理解为还包括例如已经因常规育种或基因工程方法而耐受特殊类别的除草剂施用的植物,例如羟基苯基丙酮酸双加氧酶 (HPPD) 抑制剂;乙酰乳酸合成酶 (ALS) 抑制剂如磺酰脲类(例如见 US 6,222,100、WO 01/82685、WO 00/26390、WO 97/41218、WO 98/02526、WO 98/02527、WO 04/106529、WO 05/20673、WO 03/14357、WO 03/13225、WO 03/14356、WO 04/16073) 或咪唑啉酮类(例如见 US 6,222,100、WO 01/82685、WO 00/26390、WO 97/41218、WO 98/002526、WO 98/02527、WO 04/106529、WO 05/20673、WO 03/014357、WO 03/13225、WO 03/14356、WO 04/16073);烯醇丙酮酰莽草酸 3-磷酸合成酶 (EPSPS) 抑制剂如草甘膦 (glyphosate) (例如见 WO 92/00377);谷氨酰胺合成酶 (GS) 抑制剂如草铵膦 (glufosinate) (例如见 EP-A 0242236、EP-A 242246) 或 oxynil 除草剂(例如见 US 5,559,024)。几种栽培植物已经通过常规育种(诱变)方法而耐受除草剂,例如 **Clearfield**<sup>®</sup> 夏播油菜 (Canola) 耐受咪唑啉酮类如咪草啶酸 (imazamox)。基因工程方法已经用于使栽培植物如大豆、棉花、玉米、甜菜和油菜耐受除草剂如草甘膦和草铵膦,它们中的一些可以以商标名 **RoundupReady**<sup>®</sup> (耐受草甘膦) 和 **LibertyLink**<sup>®</sup> (耐受草铵膦) 市购。

[0778] 术语“栽培植物”应理解为还包括通过使用重组 DNA 技术而能够合成一种或多种杀虫蛋白的植物,该蛋白尤其是由芽孢杆菌属 (Bacillus) 细菌已知的那些,特别是由苏云金芽孢杆菌 (Bacillus thuringiensis) 已知的那些,例如  $\delta$ -内毒素如 CryIA(b)、CryIA(c)、CryIF、CryIF(a2)、CryIIA(b)、CryIIIA、CryIIIB(b1) 或 Cry9c; 无性杀虫蛋白 (VIP) 如 VIP1、VIP2、VIP3 或 VIP3A; 线虫定居细菌的杀虫蛋白如发光杆菌属 (Photobacterium) 或致病杆菌属 (Xenorhabdus); 动物产生的毒素如蝎毒素、蜘蛛毒素、黄蜂毒素或其他昆虫特异性神经毒素;真菌产生的毒素如链霉菌属 (Streptomyces) 毒素,植物凝集素如豌豆或大麦凝集素;凝集素;蛋白酶抑制剂如胰蛋白酶抑制剂、丝氨酸蛋白酶抑制剂、patatin、半胱氨酸蛋白酶抑制剂或木瓜蛋白酶抑制剂;核糖体失活蛋白 (RIP) 如蓖麻蛋白、玉米-RIP、相思豆毒蛋白、丝瓜籽蛋白、皂草素或异株腹泻毒蛋白 (bryodin); 类固醇代谢酶如 3-羟基类固醇氧化酶、蜕皮甾类-IDP 糖基转移酶、胆固醇氧化酶、蜕皮激素抑制剂或 HMG-CoA 还原酶;离子通道阻断剂如钠通道或钙通道阻断剂;保幼激素酯酶;利尿激素受体 (helicokinin 受体);萜合成酶,联苯合成酶,壳多糖酶或葡聚糖酶。就本发明而言,这些杀虫蛋白或毒素还具体理解为前毒素、杂合蛋白、截短的或其他方面改性的蛋白。杂合蛋白的特征在于蛋白域的新型组合(例如见 WO 02/015701)。该类毒素或能够合成该类毒素的基因修饰植物的其他实例公开于例如 EP-A 374 753、WO 93/007278、WO 95/34656、EP-A 427 529、EP-A 451 878、WO 03/18810 和 WO 03/052073 中。生产该类基因修饰植物的方法对本领域熟练技术人员通常是已知的且例如描述于上述出版物中。这些含于基因修饰植物中的杀虫蛋白赋予产生这些蛋白的植物以对某些分类学上为节肢动物昆虫的害虫,尤其是甲虫(鞘翅目 (Coleoptera))、蝇(双翅目 (Diptera))、蝴蝶和蛾(鳞翅目 (Lepidoptera)) 以及植物寄生线虫(线虫纲 (Nematoda)) 的耐受性。

[0779] 术语“栽培植物”应理解为还包括通过使用重组 DNA 技术而能够合成一种或多种蛋白以增加其对细菌、病毒或真菌病原体的抗性或耐受性的植物。这类蛋白的实例是所谓的“与发病机理相关的蛋白”(PR 蛋白,例如见 EP-A 0 392 225),植物病害抗性基因(例如表达针对来自野生墨西哥土豆 *Solanum bulbocastanum* 的致病疫霉 (*Phytophthora infestans*) 的抗性基因的土豆栽培品种)或 T4 溶菌酶(例如能够合成对细菌如 *Erwinia amylovora* 具有增强抗性的这些蛋白的土豆栽培品种)。生产该类基因修饰植物的方法对本领域熟练技术人员通常是已知的且例如描述于上述出版物中。

[0780] 术语“栽培植物”应理解为还包括通过使用重组 DNA 技术而能够合成一种或多种蛋白以提高产量(例如生物质产量、谷粒产量、淀粉含量、油含量或蛋白含量),对于旱、盐或其他限制生长的环境因素的耐受性或对害虫以及真菌、细菌或其病毒病原体的耐受性的植物。

[0781] 术语“栽培植物”应理解为还包括通过使用重组 DNA 技术而含有改变量的物质含量或新物质含量以尤其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<sup>®</sup>** 油菜)。

[0782] 术语“栽培植物”应理解为还包括通过使用重组 DNA 技术而含有改变量的物质含量或新物质含量以尤其改善原料生产的植物,例如产生增加量的支链淀粉的土豆(例如 **Amflora<sup>®</sup>** 土豆)。

[0783] 通常而言,“杀虫有效量”是指对生长获得可观察到的效果所需的活性成分的量,所述效果包括坏死、死亡、阻滞、预防和去除效果,破坏效果或减少目标生物体的出现和活动的效果。对于在本发明中使用的各种化合物/组合物,杀虫有效量可以变化。组合物的杀虫有效量也会根据主要条件如所需农药效果及持续时间、目标物种、场所、施用方式等而变化。

[0784] 在土壤处理或施用于害虫居住地或巢穴的情况下,活性成分量为 0.0001-500g/100m<sup>2</sup>,优选 0.001-20g/100m<sup>2</sup>。

[0785] 在材料保护中的常规施用率例如为 0.01-1000g 活性化合物/m<sup>2</sup>被处理材料,理想的是 0.1-50g/m<sup>2</sup>。

[0786] 用于材料浸渍中的杀虫组合物通常含有 0.001-95 重量%,优选 0.1-45 重量%,更优选 1-25 重量%至少一种驱避剂和/或杀虫剂。

[0787] 为了用于处理农作物,本发明活性成分的施用率可以为 0.1-4000g/ha,理想的是 25-600g/ha,更理想的是 50-500g/ha。

[0788] 式 I 化合物通过接触(经由土壤、玻璃、墙壁、床网、地毯、植物部分或动物部分)和摄取(诱饵或植物部分)二者而有效。

[0789] 本发明化合物还可以用于对抗非作物昆虫害虫,如蚂蚁、白蚁、黄蜂、蝇、蚊、蟋蟀或蟑螂。为了用于对抗所述非作物害虫,式 I 化合物优选用于诱饵组合物中。

[0790] 诱饵可以是液体、固体或半固体制剂(例如凝胶)。固体诱饵可以制成各种适合相应用途的形状和形式,如颗粒、块、棒、片。液体诱饵可以填充到各种装置中以确保适当施用,例如敞开容器、喷雾装置、液滴供应源或蒸发源。凝胶可以基于含水基质或油性基质且可以按照粘性、水分保留或老化特性根据特定要求配制。



[0791] 用于组合物中的诱饵是具有足够的吸引力以刺激诸如蚂蚁、白蚁、黄蜂、蝇、蚊、蟋蟀等的昆虫或蟑螂食用它的产品。吸引力可以通过使用进食刺激剂或性信息素控制。食物刺激剂例如并不穷举地选自动物和 / 或植物蛋白质 ( 肉 - 鱼 - 或血液膳食, 昆虫部分、蛋黄)、动物和 / 或植物来源的脂肪和油或单 -、低聚 - 或聚有机糖类, 尤其是蔗糖、乳糖、果糖、右旋糖、葡萄糖、淀粉、果胶或甚至糖蜜或蜂蜜。水果、作物、植物、动物、昆虫的新鲜或腐败部分或其特定部分也可以用作进食刺激剂。已知性信息素更具昆虫特异性。特殊信息素描述于文献中并且对本领域熟练技术人员是已知的。

[0792] 为了用于诱饵组合物中, 活性成分的典型含量为 0.001-15 重量%, 理想的是 0.001-5 重量%活性化合物。

[0793] 式 I 化合物的配制剂如气雾剂 ( 例如在喷雾罐中)、油喷雾剂或泵喷雾剂高度适于非专业使用者来防治害虫如蝇、跳蚤、蜱、蚊或蟑螂。气雾剂配方优选由如下组分组成: 活性化合物; 溶剂如低级醇 ( 例如甲醇、乙醇、丙醇、丁醇), 酮类 ( 例如丙酮、甲基乙基酮), 沸程为约 50-250°C 的链烷烃 ( 例如煤油), 二甲基甲酰胺, N- 甲基吡咯烷酮, 二甲亚砜, 芳族烃类如甲苯、二甲苯, 水; 此外还有助剂, 例如乳化剂如山梨糖醇单油酸酯、具有 3-7mol 氧化乙烯的油基乙氧基化物、脂肪醇乙氧基化物, 芳香油如精油, 中等脂肪酸与低级醇的酯, 芳族羰基化合物; 合适的话还有稳定剂如苯甲酸钠, 两性表面活性剂, 低级环氧化物, 原甲酸三乙酯和需要的话推进剂如丙烷、丁烷、氮气、压缩空气、二甲醚、二氧化碳、氧化亚氮或这些气体的混合物。

[0794] 油喷雾配制剂与气雾剂配方的不同在于没有使用推进剂。

[0795] 对于在喷雾组合物中的使用, 活性成分含量为 0.001-80 重量%, 优选 0.01-50 重量%, 最优选 0.01-15 重量%。

[0796] 式 I 化合物及其相应的组合物还可以用于蚊香片和熏蒸片, 发烟盒、蒸发器板或长效蒸发器以及扑蛾纸、扑蛾垫或其他与热无关的蒸发器体系中。

[0797] 用式 I 化合物及其相应组合物控制由昆虫传递的传染性疾病 ( 例如疟疾、登革热和黄热病, 淋巴丝虫病以及利什曼病) 的方法也包括处理棚屋和房子的表面、空气喷雾和浸渍窗帘、帐篷、衣物、床品、采采蝇网等。施用于纤维、织物、编织物、无纺布物、网状材料或箔以及篷布上的杀虫组合物优选包含包括杀虫剂、任选的驱除剂和至少一种粘合剂的混合物。合适的驱除剂例如为 N,N- 二乙基 - 间甲苯甲酰胺 (DEET), N,N- 二乙基苯基乙酰胺 (DEPA), 1-(3- 环己烷 -1- 基羰基) -2- 甲基哌啶, (2- 羟基甲基环己基) 乙酸内酯, 2- 乙基 -1, 3- 己二醇, 避虫酮, 甲基新癸酰胺 (MNDA), 不用于昆虫防治的拟除虫菊酯如 {(+/-)-3- 烯丙基 -2- 甲基 -4- 氧代环戊 -2-(+)- 烯基 -(+)- 反式 - 菊酸酯 (Esbiothrin), 衍生于植物提取物或与植物提取物相同的驱除剂如 1, 8- 萘二烯、丁子香酚、(+)-Eucamalol (1)、(-)-1- 表 -eucamalol, 或来自诸如花皮桉 (*Eucalyptus maculata*)、蔓荆 (*Vitex rotundifolia*)、Cymbopogon martinii、香茅 (*Cymbopogon citratus*) ( 柠檬草)、亚香茅 (*Cymbopogon nardus* ( 香茅)) 的植物的粗植物提取物。合适的粘合剂例如选自如下单体的聚合物和共聚物: 脂族酸的乙烯基酯 ( 如乙酸乙烯酯和支链烷烃脂肪酸乙烯基酯), 醇的丙烯酸和甲基丙烯酸酯, 如丙烯酸丁酯、丙烯酸 2- 乙基己基酯和丙烯酸甲酯, 单烯属和二烯属不饱和烃, 如苯乙烯, 以及脂族二烯烃, 如丁二烯。

[0798] 窗帘和床品的浸渍通常通过将纺织材料浸入杀虫剂的乳液或分散体中或将它们

喷雾于床品上而进行。

[0799] 式 I 化合物及其组合物可以用于保护木质材料如树木、护栏、枕木等,以及建筑物如房子、附属建筑、工厂,还有建筑材料、家具、皮革、纤维、乙烯基制品、电线和电缆等以防蚂蚁和 / 或白蚁,并防止蚂蚁和白蚁损害作物或人类(例如当害虫侵入房子和公共设施时)。式 I 化合物不仅施用于周围的土壤表面或地板下的土壤中以保护木质材料,而且还可以施用于堆积制品如地板下混凝土、亭柱、梁、胶合板、家具等的表面,木质制品如碎料板、半包板(half board)等以及乙烯基制品如包覆的电线、乙烯基片材,绝热材料如苯乙烯泡沫等。在防止蚂蚁损害作物或人类的施用中,将本发明蚂蚁防治剂施用于作物或周围土壤,或直接施用于蚂蚁的巢穴等。

[0800] 种子处理

[0801] 式 I 化合物还适合处理种子以保护种子免受昆虫害虫,尤其是土壤昆虫害虫侵袭并保护所得植物根和芽以防土壤害虫和叶面昆虫。

[0802] 式 I 化合物尤其可以用于保护种子以防土壤害虫并保护所得植物的根和芽以防土壤害虫和叶面昆虫。优选保护植物的根和芽。更优选保护所得植物的芽以防刺吸式口器昆虫,其中最优选防止蚜虫。

[0803] 本发明因此包括一种保护种子以防昆虫,尤其是土壤昆虫并保护秧苗的根和芽以防昆虫,尤其是土壤和叶面昆虫的方法,所述方法包括使种子在播种之前和 / 或预萌发之后与通式 I 的化合物或其盐或 N-氧化物接触。特别优选其中保护植物的根和芽的方法,更优选其中保护植物芽以防刺吸式口器昆虫的方法,最优选其中保护植物芽以防蚜虫的方法。

[0804] 术语种子包括所有种类的种子和植物繁殖体,包括但不限于真正的种子、种子切片(seed piece)、吸枝、球茎、鳞茎、果实、块茎、谷粒、插条、伐条(cut shoot)等,并且在优选实施方案中指真正的种子。

[0805] 术语种子处理包括所有本领域已知的合适种子处理技术,如拌种、种子涂敷、种子撒粉、种子浸泡和种子压丸。

[0806] 本发明还包括涂有或含有活性化合物的种子。

[0807] 术语“涂有和 / 或含有”通常是指活性成分在施用时间绝大部分处于繁殖产品的表面上,但更大或更小部分的成分可能渗入繁殖产品中,这取决于施用方法。当(再)种植所述繁殖产品时,它可能吸收活性成分。

[0808] 合适的种子为各种禾谷类、根系作物、油料作物、蔬菜、香料、观赏植物的种子,例如硬粒小麦和其他小麦、大麦、燕麦、黑麦、玉米(青饲玉米和甜玉蜀黍 / 甜玉米以及大田玉米)、大豆、油料作物、十字花科植物、棉花、向日葵、香蕉、稻、油籽油菜、芜菁油菜、糖用甜菜、饲料甜菜、茄子、土豆、禾草、草坪、草皮、牧草、西红柿、韭葱、南瓜 / 笋瓜、卷心菜、刺茎莴苣、胡椒、黄瓜、甜瓜、芸苔属(Brassica)、甜瓜、菜豆、豌豆、大蒜、洋葱、胡萝卜、块茎植物如土豆、甘蔗、烟草、葡萄、矮牵牛、天竺葵 / 香叶天竺葵、三色堇和凤仙花。

[0809] 此外,活性化合物还可以用于处理由于包括基因工程方法在内的育种而耐受除草剂或杀真菌剂或杀虫剂作用的植物的种子。

[0810] 例如,活性化合物可以用于处理耐受选自磺酰脲类、咪唑啉酮类、草铵膦(glyphosate-ammonium)或草甘膦异丙胺盐(glyphosate-isopropylammonium)和类

似活性物质的除草剂的植物（例如参见 EP-A-0242236, EP-A-242246）(WO 92/00377) (EP-A-0257993, 美国专利 5, 013, 659) 或转基因农作物如棉花的种子, 后者能够产生苏云金芽孢杆菌毒素 (Bt 毒素) 以使植物耐受某些害虫 (EP-A-0142924, EP-A-0193259)。

[0811] 此外, 活性化合物还可以用于处理与现有植物相比具有修饰特性的植物的种子, 它们例如可能通过传统育种方法和 / 或突变体产生或通过重组程序而产生。例如, 已经描述了许多为修饰植物中合成的淀粉而重组修饰农作物的情形 (例如 WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806), 或具有修饰的脂肪酸组成的转基因植物种子 (WO 91/13972)。

[0812] 活性化合物的种子处理施用通过在播种植物之前和植物出苗之前对种子喷雾或撒粉而进行。

[0813] 尤其可用于种子处理的组合物例如为:

[0814] A 可溶性浓缩物 (SL、LS)

[0815] D 乳液 (EW、EO、ES)

[0816] E 悬浮液 (SC、OD、FS)

[0817] F 水分散性颗粒和水溶性颗粒 (WG、SG)

[0818] G 水分散性粉末和水溶性粉末 (WP、SP、WS)

[0819] H 凝胶配制剂 (GF)

[0820] I 可撒粉粉末 (DP、DS)

[0821] 常规种子处理配制剂例如包括可流动浓缩物 FS、溶液 LS、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 和 EC 以及凝胶配制剂 GF。这些配制剂可以经稀释或不经稀释而施用于种子上。对种子的施用在播种之前进行, 直接施用于种子上或在种子已经预萌发之后施用。

[0822] 在优选实施方案中, 将 FS 配制剂用于种子处理。FS 配制剂通常可包含 1-800g/1 活性成分, 1-200g/1 表面活性剂, 0-200g/1 防冻剂, 0-400g/1 粘合剂, 0-200g/1 颜料和达到 1 升的溶剂, 优选水。

[0823] 用于种子处理的式 I 化合物的尤其优选 FS 配制剂通常包含 0.1-80 重量% (1-800g/1) 活性成分, 0.1-20 重量% (1-200g/1) 至少一种表面活性剂, 例如 0.05-5 重量% 润湿剂和 0.5-15 重量% 分散剂, 至多 20 重量%, 例如 5-20% 防冻剂, 0-15 重量%, 例如 1-15 重量% 颜料和 / 或染料, 0-40 重量%, 例如 1-40 重量% 粘合剂 (粘结剂 / 粘附剂), 任选至多 5 重量%, 例如 0.1-5 重量% 增稠剂, 任选 0.1-2% 消泡剂和任选防腐剂如生物杀伤剂、抗氧化剂等, 例如其量为 0.01-1 重量%, 以及达到 100 重量% 的填料 / 载体。

[0824] 种子处理配制剂还可额外包含粘合剂和任选包含着色剂。

[0825] 可以加入粘合剂以改进处理之后活性物质在种子上的粘附。合适的粘合剂是氧化烯如氧化乙烯或氧化丙烯的均聚物和共聚物, 聚乙酸乙烯酯, 聚乙烯醇, 聚乙烯基吡咯烷酮及其共聚物, 乙烯 / 乙酸乙烯酯共聚物, 丙烯酸均聚物和共聚物, 聚乙烯胺, 聚乙烯酰胺和聚乙烯亚胺, 多糖如纤维素、纤基乙酸钠和淀粉, 聚烯烃均聚物和共聚物如烯烃 / 马来酸酐共聚物, 聚氨酯, 聚酯, 聚苯乙烯均聚物和共聚物。

[0826] 任选还可以在配制剂中包括着色剂。对种子处理配制剂合适的着色剂或染料是若丹明 B、C. I. 颜料红 112、C. I. 溶剂红 1、颜料蓝 15:4、颜料蓝 15:3、颜料蓝 15:2、颜料蓝 15:1、颜料蓝 80、颜料黄 1、颜料黄 13、颜料红 112、颜料红 48:2、颜料红 48:1、颜料红 57:1、

颜料红 53:1、颜料橙 43、颜料橙 34、颜料橙 5、颜料绿 36、颜料绿 7、颜料白 6、颜料棕 25、碱性紫 10、碱性紫 49、酸性红 51、酸性红 52、酸性红 14、酸性蓝 9、酸性黄 23、碱性红 10、碱性红 108。

[0827] 胶凝剂的实例是角叉菜(**Satiagel<sup>®</sup>**)。

[0828] 在种子处理中,化合物 I 的施用率通常为 0.1g-10kg/100kg 种子,优选 1g-5kg/100kg 种子,更优选 1-1000g/100kg 种子,尤其是 1-200g/100kg 种子。

[0829] 因此,本发明还涉及包含如本文所定义的式 (I) 化合物或 I 的可农用盐或 I 的 N-氧化物的种子。化合物 I 或其可农用盐或其 N-氧化物的量通常为 0.1g-10kg/100kg 种子,优选 1g-5kg/100kg 种子,尤其是 1-1000g/100kg 种子。对于特殊作物如莴苣,施用率可能更高。

[0830] 动物健康

[0831] 式 I 化合物或其可兽用盐或 N-氧化物尤其还适合用于在动物中和动物上防治寄生虫。

[0832] 因此,本发明的目的还要提供在动物中和动物上防治寄生虫的新方法。本发明的另一目的是提供对动物更安全的杀害虫剂。本发明的另一目的进一步在于提供可以与现有杀害虫剂相比以更低剂量使用的动物用杀害虫剂。本发明的另一目的是提供对寄生虫提供长的残留防治的动物用杀害虫剂。

[0833] 本发明还涉及用于在动物中和动物上防治寄生虫的含有杀寄生虫有效量的式 I 化合物或其可兽用盐或 N-氧化物和可接受的载体的组合物。

[0834] 本发明还提供了一种处理、防治、预防和保护动物以免受寄生虫侵染和感染的方法,包括对动物口服、局部或肠胃外给药或施用杀寄生虫有效量的式 I 化合物或其可兽用盐或 N-氧化物或包含它的组合物。

[0835] 本发明还提供了一种制备用于处理、防治、预防或保护动物以防寄生虫侵袭或侵染的组合物的方法,该组合物包含杀寄生虫有效量的式 I 化合物或其可兽用盐或 N-氧化物或包含它的组合物。

[0836] 化合物对抗农业害虫的活性并不意味着它们适合在动物中和动物上防治体内和体外寄生虫,后者要求例如在口服施用情况下的非催吐低剂量,与动物的代谢相容性,低毒性和安全处理。

[0837] 惊人的是,现已发现式 I 化合物适合在动物中和动物上防治体内和体外寄生虫。

[0838] 式 I 化合物或其可兽用盐或 N-氧化物和包含它们的组合物优选用于在包括温血动物(包括人)在内的动物和鱼中防治和预防侵袭和侵染。它们例如适于在哺乳动物如牛、绵羊、猪、骆驼、鹿、马、小猪、家禽、兔、山羊、狗和猫,水牛、驴、麝鹿和驯鹿,以及还有产皮动物如貂、丝鼠和浣熊,禽类如母鸡、鹅、火鸡和鸭以及鱼类如淡水鱼和咸水鱼如鲑鱼、鲤鱼和鳗鱼中防治和预防侵袭和侵染。

[0839] 式 I 化合物或其可兽用盐或 N-氧化物和包含它们的组合物优选用于在家养动物如狗或猫中防治和预防侵袭和侵染。

[0840] 在温血动物和鱼类中的侵袭包括但不限于虱、咬虱、蜱、羊鼻蝇蛆、羊蝇、螫蝇、家蝇、蝇、myiasitic 蝇幼虫、恙螨、蚋、蚊和蚤。

[0841] 式 I 化合物或其可兽用盐或 N-氧化物和包含它们的组合物适于内吸和 / 或非内

吸防治体外和 / 或体内寄生虫。它们对所有或部分发育阶段有效。

[0842] 式 I 化合物尤其可以用于防治体外寄生虫。

[0843] 式 I 化合物尤其可以用于分别防治下列目和属的寄生虫：

[0844] 蚤 (蚤目), 例如猫蚤 (*Ctenocephalides felis*)、狗蚤 (*Ctenocephalides canis*)、印鼠客蚤 (*Xenopsylla cheopis*)、致痒蚤 (*Pulex irritans*)、穿皮潜蚤 (*Tunga penetrans*) 和具带病蚤 (*Nosopsyllus fasciatus*),

[0845] 蟑螂 (蜚蠊目 -Blattodea), 例如德国小蠊 (*Blattella germanica*)、*Blattella asahinae*、美洲蟑螂 (*Periplaneta americana*)、日本大蠊 (*Periplaneta japonica*)、棕色蜚蠊 (*Periplaneta brunnea*)、*Periplaneta fuliginosa*、澳洲蜚蠊 (*Periplaneta australasiae*) 和东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*),

[0846] 蝇、蚊 (双翅目), 例如埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*)、白纹伊蚊 (*Aedes albopictus*)、刺扰伊蚊 (*Aedes vexans*)、墨西哥果蝇 (*Anastrepha ludens*)、五斑按蚊 (*Anopheles maculipennis*)、*Anopheles crucians*、白足按蚊 (*Anopheles albimanus*)、疟蚊 (*Anopheles gambiae*)、*Anopheles freeborni*、海南岛白踝按蚊 (*Anopheles leucosphyrus*)、云南微小按蚊 (*Anopheles minimus*)、四斑按蚊 (*Anopheles quadrimaculatus*)、红头丽蝇 (*Calliphora vicina*)、蛆症金蝇 (*Chrysomya bezziana*)、*Chrysomya hominivorax*、*Chrysomya macellaria*、鹿蝇 (*Chrysops discalis*)、*Chrysops silacea*、*Chrysops atlanticus*、螺旋蝇 (*Cochliomyia hominivorax*)、嗜人瘤蝇蛆 (*Cordylobia anthropophaga*)、狂怒库蠓 (*Culicoides furens*)、尖音库蚊 (*Culex pipiens*)、斑蚊 (*Culex nigripalpus*)、致倦库蚊 (*Culex quinquefasciatus*)、媒斑蚊 (*Culex tarsalis*)、*Culiseta inornata*、*Culiseta melanura*、人肤皮蝇 (*Dermatobia hominis*)、小毛厕蝇 (*Fannia canicularis*)、马蝇 (*Gasterophilus intestinalis*)、刺舌蝇 (*Glossina morsitans*)、须舌蝇 (*Glossina palpalis*)、*Glossina fuscipes*、胶舌蝇 (*Glossina tachinoides*)、*Haematobia irritans*、*Haplodiplosis equestris*、潜蝇属 (*Hippelates*)、纹皮蝇 (*Hypoderma lineata*)、*Leptoconops torrens*、*Lucilia caprina*、铜绿蝇 (*Lucilia cuprina*)、丝光绿蝇 (*Lucilia sericata*)、*Lycoria pectoralis*、沼蚊属 (*Mansonia*)、家蝇 (*Musca domestica*)、厩腐蝇 (*Muscina stabulans*)、羊狂蝇 (*Oestrus ovis*)、银足白蛉 (*Phlebotomus argentipes*)、*Psorophora columbiae*、*Psorophora discolor*、*Prosimulium mixtum*、赤尾肉蝇 (*Sarcophaga haemorrhoidalis*)、肉蝇属 (*Sarcophaga*)、*Simulium vittatum*、厩螫蝇 (*Stomoxys calcitrans*)、牛虻 (*Tabanus bovinus*)、*Tabanus atratus*、红色原虻 (*Tabanus lineola*) 和 *Tabanus similis*;

[0847] 虱 (毛虱目), 例如人头虱 (*Pediculus humanus capitis*)、人体虱 (*Pediculus humanus corporis*)、阴虱 (*Pthirus pubis*)、牛血虱 (*Haematopinus eurysternus*)、猪血虱 (*Haematopinus suis*)、牛颞虱 (*Linognathus vituli*)、*Bovicola bovis*、鸡虱 (*Menopon gallinae*)、*Menacanthus stramineus* 和 *Solenopotes capillatus*,

[0848] 壁虱和寄生螨 (寄螨目 (Parasitiformes)): 壁虱 (蜱亚目 (Ixodida)), 例如黑脚硬蜱 (*Ixodes scapularis*)、全环硬蜱 (*Ixodes holocyclus*)、太平洋硬蜱 (*Ixodes pacificus*)、棕色犬壁虱 (*Rhipicephalus sanguineus*)、安氏革螨 (*Dermacentor andersoni*)、美洲大革螨 (*Dermacentor variabilis*)、长星形壁虱 (*Amblyomma*

americanum)、Ambryomma maculatum、Ornithodoros hermsi、Ornithodoros turicata 以及寄生螨 (甲螨亚目 (Mesostigmata)), 例如柏氏禽刺螨 (Ornithonyssus bacoti) 和鸡皮刺螨 (Dermanyssus gallinae); 辐螨亚目 (Actinedida) (前气门亚目 (Prostigmata)) 和粉螨亚目 (Acaridida) (无气门目 (Astigmata)), 例如 Acarapis spp.、Cheyletiella spp.、Ornithocheyletia spp.、鼠螨属 (Myobia)、Psorergates spp.、蠕形螨属 (Demodex)、恙螨属 (Trombicula)、Listrophorus spp.、粉螨属 (Acarus)、食酪螨属 (Tyrophagus)、嗜木螨属 (Caloglyphus)、Hypodectes spp.、Pterolichus spp.、痒螨属 (Psoroptes)、疥螨属 (Chorioptes)、耳痒螨属 (Otodectes)、Sarcoptes spp.、背肛螨属 (Notoedres)、膝螨属 (Knemidocoptes)、Cytodites spp. 和 Laminosioptes spp.;

[0849] 臭虫 (Heteroptera): 温带臭虫 (Cimex lectularius)、热带臭虫 (Cimex hemipterus)、Reduvius senilis、锥蝽属 (Triatoma)、锥蝽属 (Rhodnius)、Panstrongylus ssp. 和 Arilus critatus,

[0850] 虱目 (Anoplurida), 例如 Haematopinus spp.、Linognathus spp.、Pediculus spp.、Phtirus spp. 和 Solenopotes spp.;

[0851] 食毛目 (Mallophagida) (Arnblycerina 和 Ischnocerina 亚目), 例如 Trimenopon spp.、Menopon spp.、Trinoton spp.、Bovicola spp.、Werneckiella spp.、Lepikentron spp.、Trichodectes spp. 和 Felicola spp.; 蛔虫 (线虫纲 (Nematoda)):

[0852] 金针虫和 Trichinosis (毛管目 (Trichosyringida)), 例如毛形科 (Trichinellidae) (毛形属 (Trichinella))、毛首科 (Trichuridae)、Trichuris spp.、毛细线虫属 (Capillaria);

[0853] 杆形目 (Rhabditida), 例如小杆线虫属 (Rhabditis)、Strongyloides spp.、Helicephalobus spp.;

[0854] 圆线虫目 (Strongylida), 例如 Strongylus spp.、Ancylostoma spp.、美洲钩虫 (Necator americanus)、Bunostomum spp. (钩虫)、毛圆线虫属 (Trichostrongylus)、捻转血矛线虫 (Haemonchus contortus)、Ostertagia spp.、Cooperia spp.、细颈线虫属 (Nematodirus)、Dictyocaulus spp.、Cyathostoma spp.、结节线虫属 (Oesophagostomum)、猪肾虫 (Stephanurus dentatus)、Ollulanus spp.、夏伯特线虫属 (Chabertia)、猪肾虫、气管比翼线虫 (Syngamus trachea)、Ancylostoma spp.、钩虫属 (Uncinaria)、球首线虫属 (Globocephalus)、Necator spp.、后圆线虫属 (Metastrongylus)、毛样缪勒线虫 (Muellerius capillaris)、Protostrongylus spp.、管圆线虫属 (Angiostrongylus)、Parelaphostrongylus spp.、Aleurostrongylus abstrusus 和肾膨结线虫 (Dioctophyma renale);

[0855] 肠线虫 (蛔目 (Ascaridida)), 例如似蚓蛔线虫 (Ascaris lumbricoides)、猪蛔虫 (Ascaris suum)、鸡蛔虫 (Ascaridia galli)、马副蛔虫 (Parascaris equorum)、蛲虫 (Enterobius vermicularis) (蛲虫)、犬弓首蛔虫 (Toxocara canis)、犬蛔虫 (Toxascaris leonine)、Skrjabinema spp. 和马尖尾线虫 (Oxyuris equi);

[0856] Camallanida, 例如 Dracunculus medinensis (麦地那龙线虫);

[0857] 旋尾目 (Spirurida), 例如 Thelazia spp.、丝虫属 (Wuchereria)、Brugia spp.、Onchocerca spp.、Dirofilari spp.、Dipetalonema spp.、Setaria spp.、Elaeophora

spp.、狼尾旋线虫 (*Spirocerca lupi*) 和丽线虫属 (*Habronema*)；棘头虫 (棘头动物门 (*Acanthocephala*)), 例如 *Acanthocephalus* spp.、猪巨吻棘头虫 (*Macracanthorhynchus hirudinaceus*) 和棘头虫属 (*Oncicola*)；

[0858] 扁虫类 (*Planarians*) (扁形动物门 (*Plathelminthes*))；

[0859] 肝吸虫 (*Flukes*) (吸虫纲 (*Trematoda*)), 例如肝片形吸虫属 (*Faciola*)、*Fascioloides magna*、并殖吸虫属 (*Paragonimus*)、双腔吸虫属 (*Dicrocoelium*)、布氏姜片吸虫 (*Fasciolopsis buski*)、华枝睾吸虫 (*Clonorchis sinensis*)、血吸虫属 (*Schistosoma*)、毛毕吸虫属 (*Trichobilharzia*)、有翼翼形吸虫 (*Alaria alata*)、并殖吸虫属和 *Nanocyetes* spp；

[0860] *Cercomeromorpha*, 尤其是 *Cestoda* (绦虫), 例如裂头绦虫属 (*Diphyllobothrium*)、*Tenia* spp.、棘球绦虫属 (*Echinococcus*)、犬复孔绦虫 (*Dipylidium caninum*)、*Multiceps* spp.、膜壳绦虫属 (*Hymenolepis*)、中殖孔绦虫属 (*Mesocestoides*)、*Vampirolepis* spp.、*Moniezia* spp.、*Anoplocephala* spp.、*Sirometra* spp.、*Anoplocephala* spp. 和 *Hymenolepis* spp.。

[0861] 式 I 化合物和含有它们的组合物尤其可用于防治双翅目、蚤目和蜱亚目的害虫。

[0862] 此外, 尤其优选式 I 化合物和含有它们的组合物在防治蚊中的用途。

[0863] 式 I 化合物和含有它们的组合物在防治蝇中的用途是本发明的另一优选实施方案。

[0864] 此外, 尤其优选式 I 化合物和含有它们的组合物在防治蚤中的用途。

[0865] 式 I 化合物和含有它们的组合物在防治壁虱中的用途是本发明的另一优选实施方案。

[0866] 式 I 化合物还尤其可以用于防治体内寄生虫 (蛔虫、棘头虫和扁虫类)。

[0867] 给药可以预防和治疗方式进行。

[0868] 活性化合物的给药直接或以合适的制剂形式口服、局部 / 经皮或肠胃外进行。

[0869] 为了对温血动物口服给药, 可以将式 I 化合物配制成动物饲料、动物饲料预混物、动物饲料浓缩物、丸剂、溶液、糊、悬浮液、浸液、凝胶、片剂、大丸剂和胶囊。此外, 式 I 化合物可以在其饮用水中给药于动物。对于口服给药, 所选择的剂型应为动物提供 0.01-100mg/kg 动物体重 / 天, 优选 0.5-100mg/kg 动物体重 / 天的式 I 化合物。

[0870] 或者, 式 I 化合物可以肠胃外给药于动物, 例如通过腔内、肌内、静脉内或皮下注射。式 I 化合物可以分散或溶于对于皮下注射而言生理上可接受的载体中。或者, 式 I 化合物可配制成皮下给药用植入物。此外, 式 I 化合物可以透皮给药于动物。对于肠胃外给药, 所选剂型应为动物提供 0.01-100mg/kg 动物体重 / 天的式 I 化合物。

[0871] 式 I 化合物还可以浸液、粉剂、粉末、套环、挂牌 (*medallions*)、喷雾剂、香波、滴施 (*spot-on*) 和喷淋 (*pour-on*) 配制剂形式以及以软膏或水包油或油包水乳液局部给药于动物。对于局部施用, 浸液和喷雾剂通常含有 0.5-5,000ppm, 优选 1-3,000ppm 式 I 化合物。此外, 式 I 化合物可以配制成动物, 特别是四足动物如牛和绵羊用耳贴。

[0872] 合适的制剂是：

[0873] - 溶液, 如口服溶液、稀释后口服给药用浓缩物、用于皮肤上或用于体腔内的溶液、喷淋配制剂、凝胶；

- [0874] - 口服或皮肤给药乳液和悬浮液；半固体制剂；
- [0875] - 其中将活性化合物在软膏基质中或在水包油或油包水乳液基质中加工的配制剂；
- [0876] - 固体制剂如粉末、预混物或浓缩物、颗粒、丸剂、片剂、大丸剂、胶囊；气雾剂和吸入剂，以及含有活性化合物的成型制品。
- [0877] 适合注射的组合物通过将活性成分溶于合适的溶剂中并任选加入其他成分如酸、碱、缓冲盐、防腐剂和加溶剂而制备。过滤这些溶液并无菌填充。
- [0878] 合适的溶剂是生理上耐受的溶剂如水，链烷醇如乙醇、丁醇、苄醇、甘油、丙二醇、聚乙二醇、N-甲基吡咯烷酮、2-吡咯烷酮及其混合物。
- [0879] 活性化合物可以任选溶于生理上耐受的且适合注射的植物或合成油中。
- [0880] 合适的加溶剂是促进活性化合物在主溶剂中溶解或防止其沉淀的溶剂。实例是聚乙烯基吡咯烷酮、聚乙烯醇、聚氧乙基化蓖麻油和聚氧乙基化脱水山梨糖醇酯。
- [0881] 合适的防腐剂是苄醇、三氯丁醇、对羟基苯甲酸酯和正丁醇。
- [0882] 口服溶液直接给药。浓缩物在预先稀释至使用浓度之后口服给药。口服溶液和浓缩物根据上面对注射液所述的现有技术制备，并不必需无菌程序。
- [0883] 用于皮肤上的溶液滴施、涂施、擦施、洒施或喷施。
- [0884] 用于皮肤上的溶液根据现有技术以及上面对注射液所述制备，并不必需无菌程序。
- [0885] 通常而言，“杀寄生虫有效量”是指对生长获得可观察到的效果所需的活性成分的量，所述效果包括坏死、死亡、阻滞、预防和去除效果，破坏效果或减少目标生物体的出现和活动的效果。对于在本发明中使用的各种化合物/组合物，杀寄生虫有效量可以变化。组合物的杀寄生虫有效量也会根据主要条件如所需杀寄生虫效果及持续时间、目标物种、施用方式等而变化。
- [0886] 可以用于本发明的组合物通常可以包含约 0.001-95% 式 I 化合物。
- [0887] 通常有利的是以 0.5-100mg/kg/天，优选 1-50mg/kg/天的总量施用式 I 化合物。
- [0888] 即用制剂以 10 重量 ppm-80 重量%，优选 0.1-65 重量%，更优选 1-50 重量%，最优选 5-40 重量% 的浓度含有对寄生虫，优选体外寄生虫起作用的化合物。
- [0889] 在使用前稀释的制剂以 0.5-90 重量%，优选 1-50 重量% 的浓度含有对体外寄生虫起作用的化合物。
- [0890] 此外，制剂以 10 重量 ppm-2 重量%，优选 0.05-0.9 重量%，非常特别优选 0.005-0.25 重量% 的浓度包含对抗体内寄生虫的式 I 化合物。
- [0891] 在本发明的优选实施方案中，经皮/局部施用包含式 I 化合物的组合物。
- [0892] 在另一优选实施方案中，局部施用以含有化合物的成型制品如套环、挂牌、耳贴、在身体部分上固定用的绑带以及粘合条和箔的形式进行。
- [0893] 通常有利的是施用在三周内以 10-300mg/kg，优选 20-200mg/kg，最优选 25-160mg/kg 被处理动物体重的总量释放式 I 化合物的固体配制剂。
- [0894] 为了制备成型制品，使用热塑性和柔性塑料以及弹性体和热塑性弹性体。合适的塑料和弹性体是与式 I 化合物充分相容的聚乙烯基树脂、聚氨酯、聚丙烯酸酯、环氧树脂、纤维素、纤维素衍生物、聚酰胺和聚酯。塑料和弹性体的详细列表以及成型制品的制备程序



例如在 WO 03/086075 中给出。

## 实施例

[0895] A. 制备实施例

[0896] 适当改变原料,使用下面合成实施例中所给程序得到其他化合物 II。以此方式得到的化合物与物理数据一起列于下表中。

[0897] 下面所示产物由熔点测定、NMR 光谱法或质谱 ( $[m/z]$ ) 或通过 GC MS 光谱法测定保留时间 (RT; [min.]) [GC MS = 气相色谱法 - 质谱法联用] 表征。

[0898] 仪器设定和色谱条件:

[0899] 机器:Agilent 6890N/5975B/MSD

[0900] 载气:氦气

[0901] 柱:Varian/50m VF-1/ID = 0.25mm, FD = 0.25  $\mu$ m

[0902] 注射系统:Agilent-Split/Splitless Injector/Modus Split 1:50

[0903] 注射:Agilent-Injector 7683B 系列 / 量 = 1  $\mu$ l

[0904] 检测:Agilent-MSD

[0905] 温度 / 压力:

[0906] 注射器:270 $^{\circ}$ C

[0907] MSD 界面:280 $^{\circ}$ C

[0908] 源头:230 $^{\circ}$ C

[0909] MS Quad:150 $^{\circ}$ C

[0910] 起始温度:50 $^{\circ}$ C

[0911] 停留时间 1:2min

[0912] 速率 1:10 $^{\circ}$ C /min

[0913] 终点温度:280 $^{\circ}$ C

[0914] 停留时间 2:45min

[0915] 总操作时间:70min

[0916] 压力 (prgm):恒定流, AV:31cm/sec

[0917] 隔膜吹扫:2ml/min

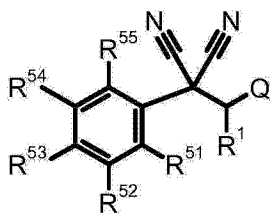
[0918] 样品制备:

[0919] 以 10% 稀释度测量化合物。

[0920] 制备 2-[(5-溴-2-吡啶基)甲基]-2-(4-氟苯基)丙二腈 (II-10) 的程序

[0921] 将 2-(4-氟苯基)丙二腈 (241mg, 1.50mmol, 1.0 当量) 溶于丙酮 (20mL) 中。加入  $K_2CO_3$  (312mg, 2.25mmol, 1.5 当量) 并将反应混合物在室温下搅拌 60 分钟。滴加甲磺酸 (5-溴-2-吡啶基) 甲基酯 (400mg, 1.50mmol, 1.0 当量) 在丙酮 (20mL) 中的溶液并将所得混合物在室温下搅拌过夜。减压除去溶剂并经由柱层析 ( $SiO_2$ , 环己烷 / 乙酸乙酯梯度 8/1  $\rightarrow$  1/1) 提纯残余物, 得到 350mg (1.06mmol, 71%) II-10。

[0922]



(II)

[0923]

化合物	R <sup>51</sup>	R <sup>52</sup>	R <sup>53</sup>	R <sup>54</sup>	R <sup>55</sup>	R <sup>1</sup>	Q	物理数据(GC-MS)	
								RT[min]	m/z[MH] <sup>+</sup>
II-1	H	H	乙炔基	H	H	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	23.767	325.1
II-2	H	H	Cl	H	H	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	23.415	335.0
II-3	H	H	H	H	H	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	21.764	301.1
II-4	H	H	H	H	H	H	5-三氟甲基吡啶-2-基	21.199	301.1
II-5	H	H	H	H	H	CH <sub>3</sub>	6-三氟甲基吡啶-3-基	21.528	311.9
II-6	H	H	F	H	H	CH <sub>3</sub>	6-三氟甲基吡啶-3-基	21.345	331.0
II-7	H	H	F	H	H	CH <sub>3</sub>	5-溴吡啶-2-基	24.640	341.0
II-8	H	H	H	H	H	CH <sub>3</sub>	5-氟吡啶-2-基	23.651	265.1
II-9	H	H	F	H	H	CH <sub>3</sub>	5-氟吡啶-2-基	21.061	283.1
II-10	H	H	F	H	H	H	5-溴吡啶-2-基	24.357	329.0
II-11	H	H	H	H	H	H	5-氟吡啶-2-基	21.875	251.1
II-12	H	H	F	H	H	H	5-氟吡啶-2-基	21.563	269.1
II-13	H	H	H	H	H	H	6-三氟甲基哒嗪-3-基	23.600	302.1
II-14	H	H	F	H	H	H	6-三氟甲基哒嗪-3-基	23.438	320.1
II-15	H	F	H	H	H	H	6-三氟甲基哒嗪-3-基	23.529	320.1
II-16	H	H	H	H	H	H	5-三氟甲基嘧啶-2-基	21.688	302.1
II-17	H	H	F	H	H	H	5-三氟甲基嘧啶-2-基	21.627	320.1
II-18	H	F	H	H	H	H	5-三氟甲基嘧啶-2-基	21.436	320.1
II-19	H	F	H	H	H	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	21.924	319.1
II-20	H	H	H	H	H	H	2-三氟甲基嘧啶-5-基	22.743	302.1
II-21	H	F	H	H	H	H	2-三氟甲基嘧啶-5-基	22.425	320.1
II-22	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	22.503	315.1
II-23	H	H	F	H	H	H	2-三氟甲基嘧啶-5-基	22.897	320.1
II-24	F	H	H	H	H	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	22.186	319.1
II-25	H	H	乙炔基	H	H	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	25.599	326.1
II-26	H	H	H	H	H	H	5-三氟甲基吡啶-2-基	22.228	302.1
II-27	H	H	F	H	H	H	5-三氟甲基吡啶-2-基	22.247	320.1
II-28	H	F	H	H	H	H	5-三氟甲基吡啶-2-基	22.290	320.1
II-29	H	H	H	H	H	H	吡啶-2-基	22.540	233.1
II-30	H	H	F	H	H	H	吡啶-2-基	22.061	251.1
II-31	H	H	H	H	H	H	吡啶-3-基	22.790	233.1
II-32	H	H	F	H	H	H	吡啶-3-基	22.758	251.1

[0924]

II-33	H	H	乙炔基	H	H	H	5-三氟甲基吡啶-2-基	25.073	326.1
II-34	H	F	H	F	H	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	21.533	337.1
II-35	H	OCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	23.871	331.1
II-36	F	H	H	H	H	H	5-三氟甲基吡啶-2-基	21.623	319.1
II-37	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	5-三氟甲基吡啶-2-基	25.333	315.2
II-38	H	F	H	F	H	H	5-三氟甲基吡啶-2-基	20.877	337.1
II-39	H	OCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	5-三氟甲基吡啶-2-基	23.510	331.1
II-40	H	CN	H	H	H	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	25.692	326.1
II-41	H	H	F	H	H	CH <sub>3</sub>	5-三氟甲基吡啶-2-基	20.748	336.1
II-42	H	F	H	F	H	CH <sub>3</sub>	5-三氟甲基吡啶-2-基	19.951	355.1
II-43	H	F	F	F	H	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	19.100	355.1
II-44	F	F	H	H	H	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	19.557	337.3
II-45	H	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	21.500	329.1
II-46	H	F	H	CF <sub>3</sub>	H	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	18.492	387.1
II-47	H	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	H	5-三氟甲基吡啶-2-基	21.086	329.1
II-48	H	F	F	F	H	H	5-三氟甲基吡啶-2-基	18.331	355.1
II-49	F	F	H	H	H	H	5-三氟甲基吡啶-2-基	19.322	337.1
II-50	H	H	H	H	H	H	2,6-二氟吡啶-3-基	20.031	269.1
II-51	H	H	F	H	H	H	2,6-二氟吡啶-3-基	19.658	287.1
II-52	H	F	H	F	H	H	2,6-二氟吡啶-3-基	18.661	305.1
II-54	H	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	17.609	437.1
II-55	H	H	OCH <sub>2</sub> O	H	H	H	5-三氟甲基吡啶-2-基	22.983	345.1
II-56	H	H	OCH <sub>2</sub> O	H	H	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	23.516	345.1
II-57	H	H	OCH <sub>2</sub> O	H	H	H	2,6-二氟吡啶-3-基	23.296	313.1
II-58	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O	H	H	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	24.858	359.1
II-59	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O	H	H	H	5-三氟甲基吡啶-2-基	24.517	359.1
II-60	H	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	H	5-三氟甲基吡啶-2-基	16.836	437.1
II-61	H	F	F	F	H	CH <sub>3</sub>	5-三氟甲基吡啶-2-基	18.443	370.1
II-62	H	H	N=CH-CH=CH	H	H	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	25.277	352.1
II-63	H	H	N=CH-CH=CH	H	H	H	2,6-二氟吡啶-3-基	25.213	320.1
II-64	H	H	N=CH-CH=CH	H	H	H	5-三氟甲基吡啶-2-基	24.793	352.1
II-65	H	F	F	F	H	H	6-甲基吡啶-2-基	20.341	301.3
II-66	H	F	F	F	H	H	3,5-二氟吡啶-4-基	26.339	356.1
II-67	F	F	I	F	F	H	6-三氟甲基吡啶-3-基	23.333	498.9

[0925] II-43 的 NMR 数据：<sup>1</sup>H-NMR(500MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  = 3.55(s, 2H), 7.22(t, 1H), 7.76(d, 1H), 7.85(d, 1H), 8.50(s, 1H)。

[0926] B. 生物学实施例

[0927] 本发明式 II 化合物的活性可以由下面所述生物学试验证实和评价。

[0928] 若无其他说明, 试验溶液按如下制备:

[0929] 将活性化合物以所需浓度溶于 1:1(体积比)蒸馏水:丙酮混合物中。在使用当天通常以 ppm 浓度(重量/体积)制备试验溶液。

[0930] B.1 豇豆蚜(Aphis craccivora)

[0931] 将活性化合物在 50:50(v/v)丙酮:水中配制。在使用当天制备试验溶液。在记

录害虫种群之后喷雾被约 100-150 只各阶段的蚜虫盘踞的盆栽豇豆植株。24、72 和 120 小时后记录种群降低。

[0932] 在该试验中,与未处理对照相比,化合物 II-2、II-3、II-4、II-5、II-6、II-8、II-14、II-15、II-16、II-17、II-19、II-20、II-21、II-23、II-26、II-28、II-38、II-41、II-42、II-43、II-47 和 II-61 分别在 500ppm 下显示出至少 75% 的死亡率。

[0933] B. 2 地中海实蝇 (*Ceratitis capitata*)

[0934] 为了评价对地中海实蝇 (*Ceratitis capitata*) 的防治,测试单元由含有昆虫膳食和 50-80 只地中海实蝇虫卵的微滴定板构成。使用含有 75 体积%水和 25 体积% DMSO 的溶液配制化合物。使用定制微雾化器将不同浓度的配制化合物以 5  $\mu$ l 喷雾于昆虫膳食上,重复两次。在施用之后,将微滴定板在约 28 $\pm$ 1 $^{\circ}$ C 和约 80 $\pm$ 5% 相对湿度下温育 5 天。然后肉眼评价卵和幼虫死亡率。

[0935] 在该试验中,与未处理对照相比,化合物 II-5、II-6、II-7、II-19、II-20、II-23、II-26、II-27、II-34、II-41、II-42、II-43、II-48 和 II-61 分别在 2500ppm 下显示出至少 75% 的死亡率。

[0936] B. 3 绿桃蚜 (*Myzus persicae*)

[0937] 为了通过内吸方式评价对绿桃蚜 (*Myzus persicae*) 的防治,测试单元由在人造膜下含有液体人工膳食的 96 孔微滴定板组成。使用含有 75 体积%水和 25 体积% DMSO 的溶液配制化合物。使用定制微雾化器将不同浓度的配制化合物吸移于蚜虫膳食上,重复两次。在施用之后,将 5-8 只成虫蚜虫置于微滴定板孔内的人工膜上。然后使蚜虫在被处理蚜虫膳食上吮吸并在约 23 $\pm$ 1 $^{\circ}$ C 和约 50 $\pm$ 5% 相对湿度下温育 3 天。然后肉眼评价蚜虫死亡率和繁殖力。

[0938] 在该试验中,化合物 II-4、II-5、II-6、II-8、II-9、II-11、II-13、II-14、II-15、II-16、II-18、II-20、II-23、II-34、II-38、II-39、II-41、II-42、II-43、II-48、II-52、II-57 和 II-61 分别在 2500mg/L 的试验溶液浓度下显示出至少 75% 的死亡率。

[0939] B. 4 兰花蓟马 (*Dichromothrips corbetti*)

[0940] 用于生物分析的兰花蓟马成虫得自持续维持在实验室条件下的种群。为了测试目的,将测试化合物在加有 0.01 体积% **Kinetic**<sup>®</sup> 表面活性剂的丙酮:水的 1:1 混合物(体积比)中稀释至 300ppm 的浓度(化合物重量:稀释剂体积)。各化合物的蓟马防治效力通过使用花浸技术评价。将塑料陪替氏皿用作测试场所。将各完整兰花的所有花瓣浸入处理溶液中并干燥。被处理的花与 10-15 只蓟马成虫一起放入各陪替氏皿中。然后用盖子覆盖陪替氏皿。所有测试场所在分析持续期间维持在连续光照和约 28 $^{\circ}$ C 的温度下。4 天后计数各花上和沿着各陪替氏皿内壁的活蓟马数。由处理前蓟马数外推蓟马死亡率程度。

[0941] 在该试验中,与未处理对照相比,化合物 II-2、II-3、II-4、II-5、II-6、II-10、II-15、II-16、II-17、II-18、II-19、II-20、II-21、II-23、II-24、II-26、II-27、II-28、II-33、II-34、II-38、II-41、II-42、II-43、II-46、II-48、II-49、II-50、II-51、II-52、II-61 和 II-65 分别在 500ppm 下显示出至少 75% 的死亡率。

[0942] B. 5 银叶粉虱 (*Bemisia argentifolii*)

[0943] 在环己酮中将活性化合物配制成在 1.3ml **ABgene**<sup>®</sup> 管中供应的 10,000ppm 溶

液。将这些管插入装备有雾化喷嘴的自动静电喷雾器中并作为储备溶液使用,在 50%丙酮:50%水(体积)中由该储备溶液产生更低稀释度。非离子表面活性剂(**Kinetic®**)以 0.01%(体积)的量包括在该溶液中。通过装备有雾化喷嘴的自动静电植株喷雾器喷雾于叶阶段的棉花植株(每盆一株)。在喷雾器通风橱中干燥各植株,然后从喷雾器中取出。将各盆置于塑料杯中并引入约 10-12 只粉虱成虫(约 3-5 天龄)。使用抽吸装置和连接于防护移液管头的 0.6cm 无毒 **Tygon®**管(R-3603)收集昆虫。然后将含有收集的昆虫的该管头轻轻地插入含有处理植株的土壤中,使昆虫爬出该管头而到达叶面上取食。将杯子用可反复使用的筛盖(150 微米网眼的聚酯筛网 PeCap,来自 Tetko, Inc.)覆盖。将试验植株在生长室中于 25°C 和 20-40%相对湿度下保持 3 天,避免直接暴露于荧光(24 小时光照期)以防止在杯内截热。在处理 3 天后评价与未处理对照植株相比较的死亡率。

[0944] 在该试验中,与未处理对照相比,化合物 II-1、II-2、II-4、II-8、II-9、II-12、II-13、II-15、II-16、II-17、II-18、II-19、II-20、II-21、II-23、II-24、II-26、II-27、II-28、II-31、II-34、II-36、II-38、II-41 和 II-42 分别在 500ppm 下显示出至少 75%的死亡率。

[0945] B. 6 南方灰翅夜蛾 (*Spodoptera eridania*)

[0946] 在环己酮中将活性化合物配制成在 1.3ml **ABgene®**管中供应的 10,000ppm 溶液。将这些管插入装备有雾化喷嘴的自动静电喷雾器中并作为储备溶液使用,在 50%丙酮:50%水(体积)中由该储备溶液产生更低稀释度。非离子表面活性剂(**Kinetic®**)以 0.01%(体积)的量包括在该溶液中。将 2 株利马豆植株(栽培品种为 Sieva)栽种到盆中并在第一真叶阶段选取进行处理。通过装备有雾化喷嘴的自动静电植株喷雾器将测试溶液喷雾于叶面。在喷雾器通风橱中干燥各植株,然后从喷雾器中取出。将各盆置于具有拉链封闭的穿孔塑料袋中。将约 10-11 只灰翅夜蛾幼虫放入该袋中并将该袋拉链封闭。将测试植株在生长室中于 25°C 和 20-40%的相对湿度下保持 4 天,避免直接暴露于荧光(24 小时光照期)以防止在袋内截热。处理后 4 天评价与未处理对照植物相比的死亡率和进食减退。

[0947] 在该试验中,与未处理对照相比,化合物 II-7、II-8、II-14、II-16、II-17 和 II-34 分别在 500ppm 下显示出至少 75%的死亡率。

[0948] 额外地,与未处理对照相比,化合物 II-5、II-6、II-8、II-19 和 II-38 分别在 300ppm 下显示出至少 75%的死亡率。

[0949] B. 7 巢菜修尾蚜 (*Megoura viciae*)

[0950] 为了通过接触或内吸方式评价对巢菜修尾蚜 (*Megoura viciae*) 的防治,测试单元由含有宽菜豆叶片的 24 孔微滴定板构成。使用含有 75 体积%水和 25 体积% DMSO 的溶液配制化合物。使用定制微雾化器将不同浓度的配制化合物以 2.5  $\mu$ l 喷雾于叶片上,重复两次。在施用之后,将叶片风干并将 5-8 只蚜虫成虫置于微滴定板孔内的叶片上。然后使蚜虫在被处理叶片上吸食并在约 23 $\pm$ 1°C 和约 50 $\pm$ 5%相对湿度下温育 5 天。然后肉眼评价蚜虫死亡率和繁殖力。

[0951] 在该试验中,与未处理对照相比,化合物 II-3、II-4、II-5、II-6、II-16、II-17、

II-18、II-19、II-20、II-21、II-23、II-26、II-27、II-28、II-34、II-38、II-41、II-42、II-43、II-48、II-61 和 II-66 分别在 2500ppm 下显示出至少 75% 的死亡率。

[0952] B. 8 烟芽夜蛾 (*Heliothis virescens*) I

[0953] 在环己酮中将活性化合物配制成在管中供应的 10,000ppm 溶液。将各管插入装备有雾化喷嘴的自动静电喷雾器中并作为储备溶液使用,在 50% 丙酮 : 50% 水 ( 体积 ) 中由该储备溶液产生更低稀释度。非离子表面活性剂 (**Kinetic®**) 以 0.01% ( 体积 ) 的量包括在该溶液中。将 2 株棉花植株种植于盆中并在子叶阶段选取用于处理。通过装备有雾化喷嘴的自动静电植株喷雾器将试验溶液喷雾于叶面。在喷雾器通风橱中干燥各植株,然后从喷雾器中取出。将各盆置于具有拉链封闭的穿孔塑料袋中。将约 10-11 只烟芽夜蛾幼虫放入该袋中并将该袋拉链封闭。将试验植株在生长室中于约 25°C 和约 20-40% 的相对湿度下保持 4 天,避免直接暴露于荧光 (24 小时光照期) 以防止在袋内截热。处理后 4 天评价与未处理对照植物相比的死亡率和进食减退。

[0954] 在该试验中,与未处理对照相比,化合物 II-3、II-5、II-6、II-11、II-26、II-31、II-50 和 II-52 分别在 2500ppm 下显示出至少 75% 的死亡率。

[0955] B. 9 墨西哥棉铃象 (*Anthonomus grandis*)

[0956] 为了评价对墨西哥棉铃象 (*Anthonomus grandis*) 的防治,测试单元由含有昆虫膳食和 20-30 只墨西哥棉铃象卵的 24 孔微滴定板构成。使用含有 75 体积% 水和 25 体积% DMSO 的溶液配制化合物。使用定制微雾化器将不同浓度的配制化合物以 20  $\mu$  l 喷雾于昆虫膳食上,重复两次。在施用之后,将微滴定板在约 23 $\pm$ 1°C 和约 50 $\pm$ 5% 相对湿度下温育 5 天。然后肉眼评价卵和幼虫死亡率。

[0957] 在该试验中,与未处理对照相比,化合物 II-1、II-2、II-3、II-4、II-5、II-6、II-7、II-8、II-9、II-10、II-13、II-14、II-15、II-16、II-17、II-18、II-19、II-20、II-21、II-23、II-24、II-25、II-26、II-27、II-28、II-31、II-34、II-36、II-38、II-41、II-42、II-43、II-48、II-52、II-61、II-62 和 II-65 分别在 2500ppm 下显示出至少 75% 的死亡率。

[0958] B. 10 神泽叶螨 (*Tetranychus kanzawai*)

[0959] 将活性化合物以所需浓度溶于 1:1 ( 体积比 ) 的蒸馏水 : 丙酮混合物中。以 0.1 体积% 的比例加入表面活性剂 (**Alkamuls®** EL 620)。在使用当天制备试验溶液。将 7-10 天龄的盆栽豇豆用自来水清洁并使用空气驱动的手持雾化器喷雾 5mL 试验溶液。使被处理植株风干并随后通过剪取具有已知螨虫种群的木薯叶片而用 20 只或更多只螨虫接种。将被处理植株置于约 25-27°C 和约 50-60% 相对湿度的保持室中。处理 72 小时后评价死亡百分数。

[0960] 在该试验中,与未处理对照相比,化合物 II-7、II-9、II-16、II-20、II-26、II-28、II-33、II-41、II-42、II-43 和 II-51 分别在 500ppm 下显示出至少 75% 的死亡率。

[0961] B. 11 稻飞虱 (*Nilaparvata lugens*)

[0962] 在喷雾前 24 小时将稻秧苗清洁并洗涤。将活性化合物在 50:50 丙酮 : 水 ( 体积比 ) 中配制并加入 0.1 体积% 表面活性剂 (EL 620)。将盆栽稻秧苗用 5ml 试验溶液喷雾,风干,置于笼中并用 10 只成虫接种。将被处理稻植株保持在约 28-29°C 和约 50-60% 的相对湿度下。72 小时后记录死亡百分数。

[0963] 在该试验中,与未处理对照相比,化合物 II-1、II-3、II-4、II-5、II-6、II-8、II-9、II-10、II-16、II-20、II-21、II-22、II-23、II-24、II-27、II-34、II-36、II-38、II-41、II-42、II-43、II-48、II-49、II-61 和 II-65 分别在 300ppm 下显示出至少 75%的死亡率。

[0964] B. 12 埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*)

[0965] 为了评价对埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*) 的防治,测试单元由含有 200  $\mu$ l 自来水 / 孔和 5-15 新孵化埃及伊蚊幼虫的 96 孔微滴定板构成。使用含有 75%水和 25% DMSO 的溶液配制化合物或混合物。使用定制微雾化器将不同浓度的配制化合物或混合物以 2.5  $\mu$ l 喷雾于昆虫膳食上,重复两次。

[0966] 在施用之后,将微滴定板在  $28 \pm 1^\circ\text{C}$ 、 $80 \pm 5\%$  相对湿度下温育 2 天。然后肉眼评价幼虫死亡率。

[0967] 在该试验中,与未处理对照相比,化合物 II-2、II-3、II-4、II-8、II-9、II-13、II-15、II-16、II-17、II-18、II-19、II-20、II-21、II-23、II-24、II-26、II-27、II-28、II-29、II-34、II-36、II-37、II-38、II-41、II-42、II-43、II-46、II-47、II-48、II-50、II-51、II-53、II-54、II-60、II-61、II-65 和 II-66 分别在 2500ppm 下显示出至少 75%的死亡率。

[0968] B. 13 绿桃蚜 (*Myzus persicae*)

[0969] 在环己酮中将活性化合物配制成在管中供应的 10,000ppm 溶液。将各管插入装备有雾化喷嘴的自动静电喷雾器中并将它们作为储备溶液使用,在 50%丙酮:50%水(体积)中由该储备溶液产生更低稀释度。非离子表面活性剂(**Kinetic®**)以 0.01%(体积)的量包括在该溶液中。在处理之前通过将来自主群体的重度侵染叶子置于处理植株的顶部而将第一真叶阶段的柿子椒植株侵染。使蚜虫经过整夜转移而实现 30-50 只蚜虫 / 植株的侵染并移走宿主叶子。然后通过装备有雾化喷嘴的自动静电植株喷雾器喷雾侵染的植株。在喷雾器通风橱中干燥各植株,取出,然后在生长室中在荧光光照下于约  $25^\circ\text{C}$  和约 20-40%的相对湿度下维持 24 小时光照期。5 天后相对于未处理对照植株上的死亡率测定被处理植株上的蚜虫死亡率。

[0970] 在该试验中,与未处理对照相比,化合物 II-5、II-6、II-7、II-8 和 II-34 分别在 300ppm 下显示出至少 75%的死亡率。

[0971] B. 14 棉蚜 (*Aphis gossypii*, 混合生命阶段)

[0972] 在环己酮中将活性化合物配制成在 1.3ml **ABgene®** 管中供应的 10,000ppm 溶液。将这些管插入装备有雾化喷嘴的自动静电喷雾器中并将它们作为储备溶液使用,在 50%丙酮:50%水(体积)中由该储备溶液产生更低稀释度。非离子表面活性剂(**Kinetic®**)以 0.01%(体积)的量包括在该溶液中。在处理之前通过将来自主蚜虫群体的重度侵染叶子置于各子叶的顶部而将子叶阶段的棉花植株用蚜虫侵染。使蚜虫经过整夜转移而实现 80-100 只蚜虫 / 植株的侵染并移走宿主叶子。然后通过装备有雾化喷嘴的自动静电植株喷雾器喷雾侵染的植株。在喷雾器通风橱中干燥各植株,从喷雾器中取出,然后在生长室中在荧光光照下于  $25^\circ\text{C}$  和 20-40%相对湿度下维持 24 小时光照期。5 天后相对于未处理对照植株上的死亡率测定被处理植株上的蚜虫死亡率。

[0973] 在该试验中,与未处理对照相比,化合物 II-5、II-6 和 II-8 分别在 300ppm 下显示

出至少 75% 的死亡率。

[0974] B. 15 稻绿蝽 (*Nezara viridula*)

[0975] 将活性化合物以所需浓度溶于 1:1 (体积比) 的蒸馏水:丙酮混合物中。以 0.01 体积%的比例加入表面活性剂 (Kinetic HV)。在使用当天制备试验溶液。将大豆荚放入可在微波下使用的衬有湿滤纸的塑料杯中并用三龄稻绿蝽接种。使用手持雾化器将约 2ml 溶液喷雾于各杯。将被处理杯保持于约 28-29°C 和约 50-60% 相对湿度下。处理 5 天后评价死亡百分数。

[0976] 在该试验中,与未处理对照相比,化合物 II-3、II-4、II-19、II-20、II-21、II-41、II-48、II-49、II-61 和 II-65 分别在 500ppm 下显示出至少 75% 的死亡率。