



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 110582503 B

(45) 授权公告日 2022. 05. 31

(21) 申请号 201880027004.5

(22) 申请日 2018.04.17

(65) 同一申请的已公布的文献号
申请公布号 CN 110582503 A

(43) 申请公布日 2019.12.17

(30) 优先权数据
17167707.3 2017.04.24 EP

(85) PCT国际申请进入国家阶段日
2019.10.23

(86) PCT国际申请的申请数据
PCT/EP2018/059727 2018.04.17

(87) PCT国际申请的公布数据
W02018/197257 DE 2018.11.01

(73) 专利权人 拜耳公司
地址 德国勒沃库森

(72) 发明人 N·考施-布希斯 R·菲舍尔
D·哈格 L·霍夫梅斯特
M·莫斯林 D·维尔基
M·维洛特 K·伊尔格 M·韦伯
A·李秦思盖 U·戈杰恩斯
A·特伯格

(74) 专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司 11285
专利代理师 侯婧 董金玲

(51) Int. Cl.
C07D 495/04 (2006.01)
A01N 43/50 (2006.01)

审查员 张楠

权利要求书4页 说明书110页

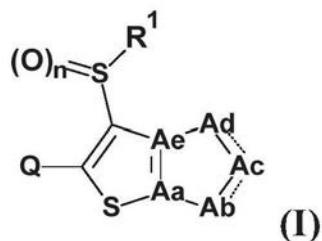
(54) 发明名称

作为有害物防治剂的稠合双环杂环化合物
衍生物

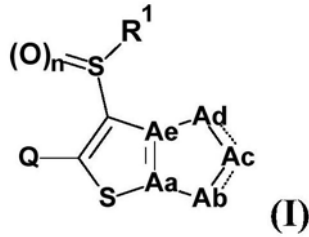
(57) 摘要

本发明涉及：新的式(I)的稠合双环杂环化合物衍生物，其中Aa、Ab、Ac、Ad、Ae、R¹、Q和n具有上述含义；含有式(I)的化合物的农业化学制剂；以及其作为杀螨剂和/或杀昆虫剂用于防治动物类有害物、主要是节肢动物且特别是昆虫和蛛形

纲动物的用途。



1. 式 (I) 的化合物



其中 代表两个单键或一个双键和一个单键，

其中，

如果 代表一个双键和一个单键，从而Aa至Ae形成芳族环，则

Aa代表碳，

Ab代表氮或C(R¹¹)，

Ac代表C(R¹²)，

Ad代表氧、硫，

Ae代表碳，

或者，在 仅代表单键的情况下，

Aa代表碳，

Ab代表C(R¹¹)(R¹⁵)，

Ac代表C(R¹²)(R¹⁶)，以及

Ad代表C(R¹³)(R¹⁷)，

Ae代表碳，

R¹代表(C₁-C₆)-烷基，

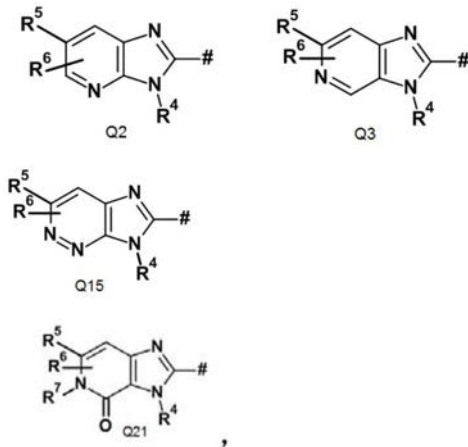
R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷彼此独立地代表氢、氰基、卤素、羟基、(C₃-C₈)-环烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基、氨基羰基、-NHC(O)-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₈)-环烷基羰基氨基、-NHCONH-(C₁-C₆)-烷基，或

代表苯基或5-元或6-元杂芳基，它们各自任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代，其中在杂芳基的情况下，杂原子选自N，在每种情况下可能的取代基如下：卤素、(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基，

其中R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷基团中至多两个代表除氢以外的取代基，

或者，在 仅代表单键的情况下，R¹¹和R¹⁵和/或R¹³和R¹⁷在每种情况下另外一起代表=0，

Q代表选自Q2、Q3、Q15和Q21的杂芳族9元稠合双环体系，



其中

R^4 代表 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基，，

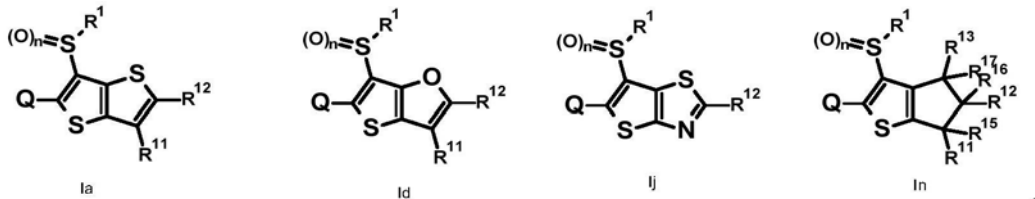
R^5 、 R^6 彼此独立地代表氢、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基硫基、 (C_1-C_6) -卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) -卤代烷基磺酰基，

R^7 代表 (C_1-C_6) -烷基，

和

n 代表2。

2. 根据权利要求1所述的式(I)的化合物，其特征在于其对应于式(Ia)、(Id)、(Ij)和(In)的化合物之一，



其中

R^1 代表 (C_1-C_4) -烷基，

R^{13} 代表氢或卤素，

R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 代表氢，

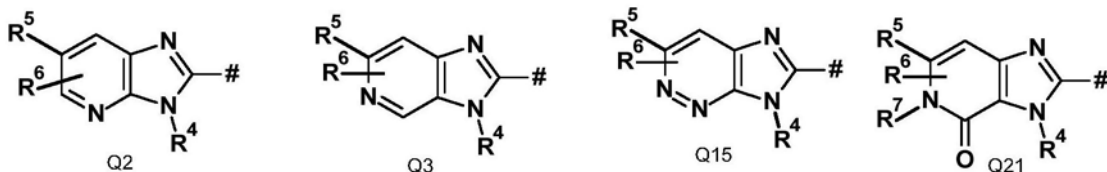
R^{11} 、 R^{12} 彼此独立地代表氢、羟基、氰基、卤素、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、氨基羰基、 $-NHC(O)-$ (C_1-C_4) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基羰基氨基、 $-NHCONH-$ (C_1-C_4) -烷基、苯基，

或代表吡唑或三唑，它们各自任选地被 (C_1-C_4) -烷基、卤素单取代，

或者，在结构式(In)的情况下， R^{11} 和 R^{15} 或 R^{13} 和 R^{17} 在每种情况下另外一起代表=O，

R^{11} 还代表 (C_1-C_4) -卤代烷基咪唑，

Q代表选自Q2、Q3、Q15和Q21的杂芳族9元稠合双环体系，



R^4 代表 (C_1-C_4) -烷基，

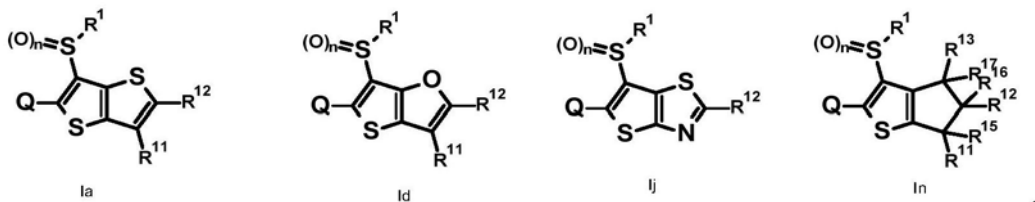
R^5 代表 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷硫基、 (C_1-C_4) -卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基亚磺酰基，

R^6 代表氢，并且

R^7 代表 (C_1-C_4) -烷基，和

n 代表2。

3. 根据权利要求1所述的式 (I) 的化合物，其特征在于其对应于式 (Ia)、(Id)、(Ij) 和 (In) 的化合物之一，



其中

R^1 代表乙基，

R^{13} 代表氢或氟，

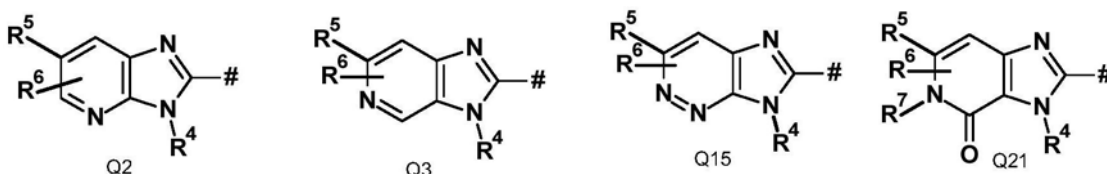
R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 代表氢，

R^{11} 代表氢、羟基、氰基、环丙基、三氟甲基、溴、碘、氟、氨基羰基、甲基氨基羰基、甲基羰基氨基、环丙基羰基氨基、(N-甲基氨基甲酰基)氨基、苯基、N-甲基吡唑、三氟甲基咪唑或氯吡唑，

R^{12} 代表氢、环丙基、甲基、三氟甲基或氯，

或者，在结构式 (In) 的情况下， R^{11} 和 R^{15} 或 R^{13} 和 R^{17} 在每种情况下另外一起代表=0，

Q代表选自Q2、Q3、Q15和Q21的杂芳族9元稠合双环体系，



R^4 代表甲基，

R^5 代表三氟甲基、三氟甲基磺酰基、三氟甲硫基、三氟甲基亚磺酰基或五氟乙基，

R^6 代表氢，

R^7 代表甲基，

和

n 代表2。

4. 根据权利要求2所述的式 (I) 的化合物，其特征在于对于式 (Ia)、(Id)、(Ij) 的化合物， R^{11} 或 R^{12} 基团中至少一个代表与氢不同的基团。

5. 农业化学制剂，其包含根据权利要求1至4中任一项所述的式 (I) 的化合物，以及增量剂和/或表面活性剂。

6. 根据权利要求5所述的农业化学制剂，其还包含其他农业化学活性成分。

7. 防治动物类有害物的方法，其特征在于，使根据权利要求1至4中任一项所述的式 (I) 的化合物或根据权利要求5或6所述的农业化学制剂作用于动物类有害物和/或其生境；其

中排除用于人体或动物体的外科或治疗性治疗的方法以及在人体或动物体上进行的诊断方法。

8. 根据权利要求1至4中任一项所述的式(I)的化合物或根据权利要求5或6所述的农业化学制剂用于制备防治动物类有害物的农药的用途。

作为有害物防治剂的稠合双环杂环化合物衍生物

[0001] 本发明涉及新的式(I)的稠合双环杂环衍生物,包含式(I)的化合物的农业化学制剂及其作为杀螨剂和/或杀昆虫剂用于防治动物类有害物、尤其是节肢动物且特别是昆虫和蛛形纲动物的用途。

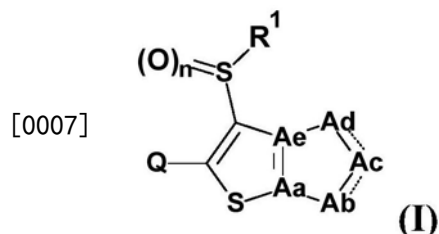
[0002] 具有杀昆虫特性的稠合双环杂环衍生物已记载于以下文献中:例如WO 2010/125985、WO 2013/180193、WO 2016/039444、WO 2016/129684、WO 2016/142327、WO 2016/169882、WO 2016/169886、WO 2017/001311、WO 2016/162318、WO 2017/093180、WO 2017/125340、WO 2017/144341、EP 16184163.0、EP 16189445.6和EP 16200177.0。

[0003] 现代杀昆虫剂和杀螨剂必须满足许多要求,例如与其作用程度、作用持久性和作用谱以及可能的用途相关的要求。毒性、有益物种和传粉昆虫的保留、环境特性、施用率、与其他活性成分或制剂助剂的结合性的问题起作用,合成活性成分中所涉及的复杂性的问题也起作用,并且还会发生抗性,仅提及一些参数。仅出于所有这些原因,不能认为对新的作物保护组合物的探寻已完成,而是不断需要与已知化合物相比至少在个别方面具有改进特性的新的化合物。

[0004] 本发明的一个目的是提供用于防治动物类有害物的化合物,该化合物在多个方面拓宽农药谱。

[0005] 现已发现新的稠合双环杂环衍生物,它们具有优于已知化合物的优点,实例包括更好的生物学特性或环境特性、更广泛的施用方法、更好的杀昆虫作用或杀螨作用,以及与作物植物良好的相容性。稠合双环杂环衍生物可与其他试剂组合使用,用于改进功效,尤其是抵抗难以防治的昆虫的功效。

[0006] 因此,本发明的主题是新的式(I)的化合物(构型1-1):



[0008] 其中 --- 代表两个单键或一个双键和一个单键,

[0009] 其中,

[0010] 如果 --- 代表一个双键和一个单键,从而Aa至Ae形成芳族环,则Aa代表氮或碳,

[0011] Ab代表氮、氧、硫、N(R⁸)或C(R¹¹),

[0012] Ac代表氮、氧、硫或C(R¹²),

[0013] Ad代表氮、氧、硫、N(R⁸)或C(R¹³),

[0014] Ae代表氮或碳,

[0015] 其中R⁸代表(C₁-C₄)-烷基、环丙基或氢,并且

[0016] 其中基团Aa、Ab、Ac、Ad和Ae中至多三个可代表氮并且基团Ab、Ac和Ad中至多一个可代表氧或基团Ab、Ac和Ad中至多一个可代表硫或基团Ab和Ad中至多一个可代表N(R⁸),

[0017] 或者,在 --- 仅代表单键的情况下,

- [0018] Aa代表碳，
- [0019] Ab代表硫、氧或C(R¹¹)(R¹⁵)，
- [0020] Ac代表硫、氧或C(R¹²)(R¹⁶)，以及
- [0021] Ad代表硫、氧或C(R¹³)(R¹⁷)，
- [0022] Ae代表碳，
- [0023] 其中基团Aa、Ab、Ac、Ad和Ae中至多一个可代表氧或硫，
- [0024] R¹代表(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基、(C₁-C₆)-氰基烷基、(C₁-C₆)-羟基烷基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-烯氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-卤代烯氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-卤代烯基、(C₂-C₆)-氰基烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₂-C₆)-炔氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-卤代炔氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-卤代炔基、(C₂-C₆)-氰基炔基、(C₃-C₈)-环烷基、(C₃-C₈)-环烷基-(C₃-C₈)-环烷基、(C₁-C₆)-烷基-(C₃-C₈)-环烷基、卤代-(C₃-C₈)-环烷基、氨基、(C₁-C₆)-烷基氨基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基、(C₃-C₈)-环烷基氨基、(C₁-C₆)-烷基羰基氨基、(C₁-C₆)-烷硫基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷硫基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷硫基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基氨基、氨基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基氨基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基，
- [0025] 或代表(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₃-C₈)-环烷基，它们各自任选地被相同或不同的选自芳基、杂芳基和杂环基的取代基单取代或多取代，其中芳基、杂芳基或杂环基可各自任选地被相同或不同的选自以下的取代基单取代或多取代：卤素、氰基、硝基、羟基、氨基、羧基、氨基甲酰基、氨基磺酰基、(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-卤代烷基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基、(C₁-C₆)-烷硫基、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基、(C₁-C₆)-烷基硫亚氨基((C₁-C₆)-alkylsulfimino)、(C₁-C₆)-烷基硫亚氨基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基硫亚氨基-(C₂-C₆)-烷基羰基、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基((C₁-C₆)-alkylsulfoximino)、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基-(C₂-C₆)-烷基羰基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基、(C₁-C₆)-烷基羰基、(C₃-C₆)-三烷基甲硅烷基和苄基，
- [0026] R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷彼此独立地代表氢、氰基、卤素、硝基、羟基、氨基、三-(C₁-C₆)-烷基甲硅烷基、(C₃-C₈)-环烷基、(C₃-C₈)-环烷基-(C₃-C₈)-环烷基、(C₁-C₆)-烷基-(C₃-C₈)-环烷基、卤代-(C₃-C₈)-环烷基、(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基、(C₁-C₆)-氰基烷基、(C₁-C₆)-羟基烷基、羟基羰基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-卤代烯基、(C₂-C₆)-氰基烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₂-C₆)-卤代炔基、(C₂-C₆)-氰基炔基、(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基、(C₁-C₆)-氰基烷氧基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)-烷基-(C₁-C₆)-烷氧基亚氨基、(C₁-


C_6)-卤代烷基-(C_1-C_6)-烷氧基亚氨基、(C_1-C_6)-烷硫基、(C_1-C_6)-卤代烷硫基、(C_1-C_6)-烷氧基-(C_1-C_6)-烷硫基、(C_1-C_6)-烷硫基-(C_1-C_6)-烷基、(C_1-C_6)-烷基亚磺酰基、(C_1-C_6)-卤代烷基亚磺酰基、(C_1-C_6)-烷氧基-(C_1-C_6)-烷基亚磺酰基、(C_1-C_6)-烷基亚磺酰基-(C_1-C_6)-烷基、(C_1-C_6)-烷基磺酰基、(C_1-C_6)-卤代烷基磺酰基、(C_1-C_6)-烷氧基-(C_1-C_6)-烷基磺酰基、(C_1-C_6)-烷基磺酰基-(C_1-C_6)-烷基、(C_1-C_6)-烷基磺酰基氧基、(C_1-C_6)-烷基羰基、(C_1-C_6)-烷基硫代羰基、(C_1-C_6)-卤代烷基羰基、(C_1-C_6)-烷基羰基氧基、(C_1-C_6)-烷氧基羰基、(C_1-C_6)-卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C_1-C_6)-烷基氨基羰基、(C_1-C_6)-烷基氨基硫代羰基、二-(C_1-C_6)-烷基氨基羰基、二-(C_1-C_6)-烷基氨基硫代羰基、(C_2-C_6)-烯基氨基羰基、二-(C_2-C_6)-烯基氨基羰基、(C_3-C_8)-环烷基氨基羰基、(C_1-C_6)-烷基磺酰基氨基、(C_1-C_6)-烷基氨基、二-(C_1-C_6)-烷基氨基、(C_3-C_8)-环烷基氨基、氨基磺酰基、(C_1-C_6)-烷基氨基磺酰基、二-(C_1-C_6)-烷基氨基磺酰基、(C_1-C_6)-烷基亚砷亚氨基、氨基硫代羰基、(C_1-C_6)-烷基氨基硫代羰基、二-(C_1-C_6)-烷基氨基硫代羰基、(C_1-C_6)-烷基羰基氨基(NHCO-(C_1-C_6)-烷基)、(C_3-C_8)-环烷基羰基氨基、(C_1-C_6)-烷基羰基-(C_1-C_6)-烷基氨基(-N-(C_1-C_6)-烷基-CO-(C_1-C_6)-烷基)、((C_1-C_6)-烷氧基羰基)氨基(-NHCOO-(C_1-C_6)-烷基)、((C_1-C_6)-烷氧基羰基)-(C_1-C_6)-烷基氨基(-N-(C_1-C_6)-烷基-COO-(C_1-C_6)-烷基)、(C_1-C_6)-烷基氨基甲酰氧基(-OCONH-(C_1-C_6)-烷基)、二-(C_1-C_6)-烷基氨基甲酰氧基(-OCON-(C_1-C_6)-二烷基)、(N-(C_1-C_6)-烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCONH-(C_1-C_6)-烷基)、(N,N-二-(C_1-C_6)-烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCON-(C_1-C_6)-二烷基)、(N-(C_1-C_6)-烷基氨基甲酰基)-(C_1-C_6)-烷基氨基(-N-(C_1-C_6)-烷基-CONH-(C_1-C_6)-烷基)、(N,N-二-(C_1-C_6)-烷基氨基甲酰基)-(C_1-C_6)-烷基氨基(-N-(C_1-C_6)-烷基-CON-(C_1-C_6)-二烷基)、氨基甲酰基氨基(-NHCONH₂)、(氨基甲酰基)-N-(C_1-C_6)-烷基氨基(-N-(C_1-C_6)-烷基-CONH₂)或

[0027] 代表芳基或杂芳基,它们各自任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代,其中(在杂芳基的情况下)可任选地存在至少一个羰基,并且其中在每种情况下可能的取代基如下:氰基、羧基、卤素、硝基、羟基、氨基、三-(C_1-C_6)-烷基甲硅烷基、(C_3-C_8)-环烷基、(C_3-C_8)-环烷基-(C_3-C_8)-环烷基、(C_1-C_6)-烷基-(C_3-C_8)-环烷基、卤代-(C_3-C_8)-环烷基、(C_1-C_6)-烷基、(C_1-C_6)-卤代烷基、(C_1-C_6)-氰基烷基、(C_1-C_6)-羟基烷基、羟基羰基-(C_1-C_6)-烷氧基、(C_1-C_6)-烷氧基羰基-(C_1-C_6)-烷基、(C_1-C_6)-烷氧基-(C_1-C_6)-烷基、(C_2-C_6)-烯基、(C_2-C_6)-卤代烯基、(C_2-C_6)-氰基烯基、(C_2-C_6)-炔基、(C_2-C_6)-卤代炔基、(C_2-C_6)-氰基炔基、(C_1-C_6)-烷氧基、(C_1-C_6)-卤代烷氧基、(C_1-C_6)-氰基烷氧基、(C_1-C_6)-烷氧基羰基-(C_1-C_6)-烷氧基、(C_1-C_6)-烷氧基-(C_1-C_6)-烷氧基、(C_1-C_6)-烷基羟基亚氨基、(C_1-C_6)-烷氧基亚氨基、(C_1-C_6)-烷基-(C_1-C_6)-烷氧基亚氨基、(C_1-C_6)-卤代烷基-(C_1-C_6)-烷氧基亚氨基、(C_1-C_6)-烷硫基、(C_1-C_6)-卤代烷硫基、(C_1-C_6)-烷氧基-(C_1-C_6)-烷硫基、(C_1-C_6)-烷硫基-(C_1-C_6)-烷基、(C_1-C_6)-烷基亚磺酰基、(C_1-C_6)-卤代烷基亚磺酰基、(C_1-C_6)-烷氧基-(C_1-C_6)-烷基亚磺酰基、(C_1-C_6)-烷基亚磺酰基-(C_1-C_6)-烷基、(C_1-C_6)-烷基磺酰基、(C_1-C_6)-卤代烷基磺酰基、(C_1-C_6)-烷氧基-(C_1-C_6)-烷基磺酰基、(C_1-C_6)-烷基磺酰基-(C_1-C_6)-烷基、(C_1-C_6)-烷基磺酰基氧基、(C_1-C_6)-烷基羰基、(C_1-C_6)-卤代烷基羰基、(C_1-C_6)-烷基羰基氧基、(C_1-C_6)-烷氧基羰基、(C_1-C_6)-卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C_1-C_6)-烷基氨基羰基、二-(C_1-C_6)-烷基氨基羰基、(C_2-C_6)-烯基氨基羰基、二-(C_2-C_6)-烯基氨基羰基、(C_3-C_8)-环烷基氨基羰基、(C_1-C_6)-烷基磺酰基氨基、(C_1-C_6)-烷基氨基、二-(C_1-C_6)-烷基氨基、氨基磺酰

基、(C₁-C₆)-烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆)-烷基亚砷亚氨基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆)-烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基硫代羰基、(C₃-C₈)-环烷基氨基或(C₁-C₆)-烷基羰基氨基,

[0028] 其中R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷基团中至多两个代表除氢以外的取代基,

[0029] 并且,在R¹¹和R¹⁵、R¹²和R¹⁶或R¹³和R¹⁷均不代表氢的情况下,R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷彼此独立地各自仅代表氰基、卤素、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基-(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基或(C₁-C₄)-氰基烷基,

[0030] 或者,在仅代表单键的情况下,R¹¹和R¹⁵和/或R¹³和R¹⁷在每种情况下另外一起代表氧(=O),

[0031] Q代表部分饱和的或饱和的杂环或杂芳族8元、9元、10元、11元或12元稠合双环或三环环体系,其可任选地包含至少一个羰基基团和/或其中所述环体系任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代,其中所述取代基彼此独立地可选自氰基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三-(C₁-C₆)-烷基甲硅烷基、卤代-(C₃-C₈)-环烷基、(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基、(C₁-C₆)-氰基烷基、(C₁-C₆)-羟基烷基、羟基羰基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-卤代烯基、(C₂-C₆)-氰基烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₂-C₆)-炔氧基-(C₁-C₄)-烷基、(C₂-C₆)-卤代炔基、(C₂-C₆)-氰基炔基、(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-卤代烯氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-氰基烷氧基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)-烷基-(C₁-C₆)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)-卤代烷基-(C₁-C₆)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)-烷硫基、(C₁-C₆)-卤代烷硫基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷硫基、(C₁-C₆)-烷硫基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)-卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基、(C₁-C₆)-卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基磺酰基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆)-烷基羰基、(C₁-C₆)-烷基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基硫代羰基、(C₁-C₆)-卤代烷基羰基、(C₁-C₆)-烷基羰基氧基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆)-烷基氨基羰基、(C₁-C₆)-烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基羰基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基硫代羰基、(C₂-C₆)-烯基氨基羰基、二-(C₂-C₆)-烯基氨基羰基、(C₃-C₈)-环烷基氨基羰基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆)-烷基氨基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆)-烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₆)-烷基-氨基磺酰基、(C₁-C₆)-烷基亚砷亚氨基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆)-烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基硫代羰基、(C₃-C₈)-环烷基氨基、NHCO-(C₁-C₆)-烷基((C₁-C₆)-烷基羰基氨基),或者任选地被单氰基取代的(C₃-C₈)-环烷基、(C₃-C₈)-环烷基-(C₃-C₈)-环烷基或(C₁-C₄)-烷基-(C₃-C₈)-环烷基,

[0032] 或其中所述取代基彼此独立地可选自苯基和5元或6元杂芳族环,其中苯基和所述环可任选地被相同或不同的选自以下的取代基单取代或多取代:C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₂-C₆-卤代烯基、C₂-C₆-卤代炔基、C₃-C₆-卤代环烷基、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基,和

[0033] n代表0、1或2。

[0034] 此外,已发现式(I)的化合物作为农药、优选作为杀昆虫剂和/或杀螨剂具有非常好的功效,并且还通常具有非常好的植物相容性,特别是对于作物植物而言。

[0035] 本发明的化合物由式(I)以一般性术语定义。在上下文提及的式中给出的优选的取代基或基团的范围在下文中举例说明:

[0036] 构型2-1

[0037] 式(I)的化合物,其中优选地,

[0038] 在  代表一个单键和一个双键,从而Aa至Ae形成芳族环的情况下,

[0039] Aa代表氮或碳,

[0040] Ab代表氮、氧、硫、N(R⁸)或C(R¹¹),

[0041] Ac代表氮、氧、硫或C(R¹²),

[0042] Ad代表氮、氧、硫、N(R⁸)或C(R¹³),

[0043] Ae代表氮或碳,

[0044] 其中R⁸代表甲基、乙基、环丙基或氢,并且

[0045] 其中基团Aa、Ab、Ac、Ad和Ae中至多三个可代表氮并且基团Ab、Ac和Ad中至多一个可代表氧或基团Ab、Ac和Ad中至多一个可代表硫或基团Ab和Ad中至多一个可代表N(R⁸),

[0046] 或者,如果  仅代表单键,则

[0047] Aa代表碳,

[0048] Ab代表硫、氧或C(R¹¹)(R¹⁵),

[0049] Ac代表硫、氧或C(R¹²)(R¹⁶),以及

[0050] Ad代表硫、氧或C(R¹³)(R¹⁷),

[0051] Ae代表碳,

[0052] 其中基团Aa、Ab、Ac、Ad和Ae中至多一个可代表氧或硫,

[0053] R¹优选代表(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-羟基烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-卤代烯基、(C₂-C₄)-炔基、(C₂-C₄)-卤代炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷硫基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷硫基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基-(C₁-C₄)-烷基或(C₁-C₄)-烷基磺酰基-(C₁-C₄)-烷基,

[0054] R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷彼此独立地优选代表氢、氰基、卤素、硝基、羟基、氨基、三-(C₁-C₆)-烷基甲硅烷基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基-(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-氰基烷基、(C₁-C₄)-羟基烷基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-卤代烯基、(C₂-C₄)-氰基烯基、(C₂-C₄)-炔基、(C₂-C₄)-卤代炔基、(C₂-C₄)-氰基炔基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基、(C₁-C₄)-氰基烷氧基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-烷基羟基亚氨基、(C₁-C₄)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₄)-烷基-(C₁-C₄)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₄)-卤代烷基-(C₁-C₄)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₄)-烷硫基、(C₁-C₄)-卤代烷硫基、(C₁-C₄)-烷硫基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基氧基、(C₁-C₄)-烷基羰基、(C₁-C₄)-卤代烷基羰基、氨基羰基、氨基硫代羰基、(C₁-C₄)-烷基氨基羰基、二-(C₁-C₄)-烷基氨基羰基、(C₃-C₆)-环烷基氨基羰基、(C₁-

C_4)-烷基磺酰基氨基、 (C_1-C_4) -烷基氨基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基磺酰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基磺酰基、氨基硫代羰基、 (C_1-C_4) -烷基羰基氨基、 (C_1-C_4) -烷基羰基氨基(-NHCO- (C_1-C_4) -烷基)、 (C_3-C_6) -环烷基羰基氨基、 (C_1-C_4) -烷基羰基- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CO- (C_1-C_6) -烷基)、 (C_1-C_4) -烷氧基羰基)氨基(-NHCOO- (C_1-C_4) -烷基)、 (C_1-C_4) -烷氧基羰基)- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-COO- (C_1-C_6) -烷基)、 (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰氧基(-OCONH- (C_1-C_4) -烷基)、二- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰氧基(-OCON- (C_1-C_6) -二烷基)、(N- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCONH- (C_1-C_4) -烷基)、(N,N-二- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCON- (C_1-C_4) -二烷基)、(N- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CONH- (C_1-C_4) -烷基)、(N,N-二- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CON- (C_1-C_4) -二烷基)、氨基甲酰基氨基(-NHCONH₂)、(氨基甲酰基)-N- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CONH₂)

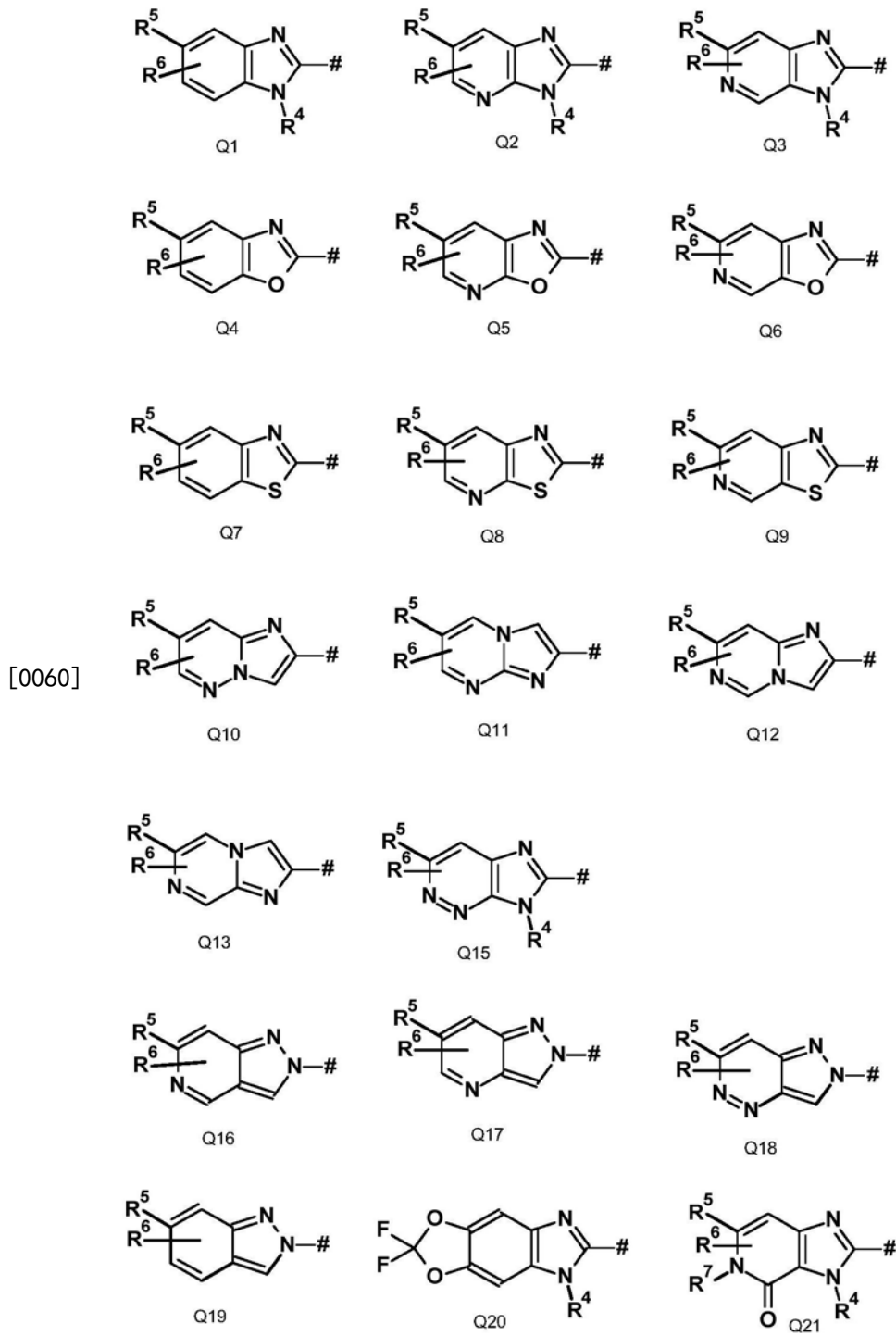
[0055] 或优选代表苯基或5元或6元杂芳基,它们各自任选地被相同或不同的取代基单取代或二取代,其中(在杂芳基的情况下)可任选地存在至少一个羰基并且杂原子选自N、S和O,并且其中在每种情况下可能的取代基如下:氰基、卤素、乙酰基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基- (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -氰基烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -炔基、 (C_2-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -烷硫基、 (C_1-C_4) -卤代烷硫基、 (C_1-C_4) -烷硫基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基氧基、 (C_1-C_4) -烷基羰基、氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基氨基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基磺酰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基磺酰基或 (C_1-C_4) -烷基羰基氨基,

[0056] 其中 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 基团中至多两个代表除氢以外的取代基,

[0057] 并且,在 R^{11} 和 R^{15} 、 R^{12} 和 R^{16} 或 R^{13} 和 R^{17} 均不代表氢的情况下, R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 彼此独立地各自仅代表氰基、卤素、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基- (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基或 (C_1-C_4) -氰基烷基,

[0058] 或者,在 --- 仅代表单键的情况下, R^{11} 和 R^{15} 和/或 R^{13} 和 R^{17} 在每种情况下另外一起优选代表氧(=O),

[0059] Q优选代表选自Q1至Q13和Q15至Q21的杂芳族9元或12元稠合双环或三环环体系:



[0061] 其中，

[0062] R^4 优选代表 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -氰基烷基、 (C_1-C_4) -羟基烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -烯氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -卤代烯氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -卤代烯基、 (C_2-C_4) -氰基烯基、 (C_2-C_4) -炔基、 (C_2-C_4) -炔氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -卤代炔基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基- (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷硫基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基- (C_1-C_4) -烷基或 (C_1-C_4) -烷基羰基- (C_1-C_4) -烷基，

[0063] R^5 、 R^6 彼此独立地优选代表氢、氰基、卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -卤代烯基、 (C_2-C_4) -炔基、 (C_2-C_4) -卤代炔基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷氧基亚氨基、 (C_1-C_4) -烷硫基、 (C_1-C_4) -卤代烷硫基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基氧基、 (C_1-C_4) -烷基羰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基羰基、氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基氨基、 (C_1-C_4) -烷基氨基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基磺酰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基磺酰基或者任选地被单氰基取代的 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基- (C_3-C_6) -环烷基或 (C_1-C_4) -烷基- (C_3-C_6) -环烷基，

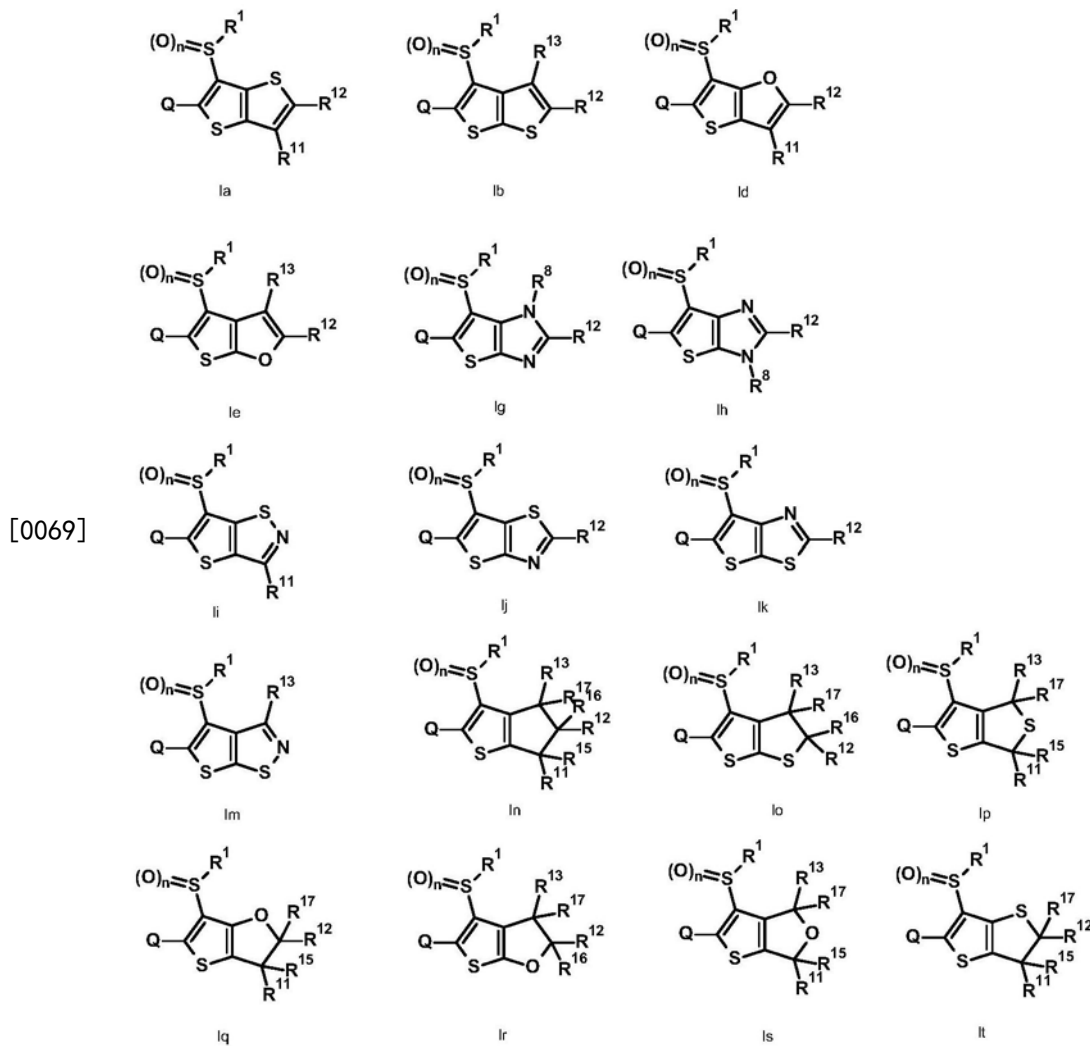
[0064] R^7 优选代表氢、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -氰基烷基、 (C_1-C_4) -羟基烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -烯氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -卤代烯氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -卤代烯基、 (C_2-C_4) -氰基烯基、 (C_2-C_4) -炔基、 (C_2-C_4) -卤代炔基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基- (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷硫基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) -烷基或 (C_1-C_4) -烷基磺酰基- (C_1-C_4) -烷基，

[0065] 和

[0066] n优选为0、1或2。

[0067] 构型3-1

[0068] 式(Ia)、(Ib)、(Id)、(Ie)、(Ig)至(Ik)和(Im)至(It)的化合物，



[0070] 其中，

[0071] R^1 特别优选代表 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基或 (C_3-C_6) -环烷基，

[0072] R^8 特别优选代表甲基、乙基、环丙基或氢，

[0073] R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 彼此独立地特别优选代表氢、氰基、卤素、硝基、羟基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基- (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷基磺基、 (C_1-C_4) -卤代烷基磺基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基磺酰基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基磺酰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基磺酰基、氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、 (C_3-C_6) -环烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基羰基氨基(-NHCO- (C_1-C_4) -烷基)、 (C_3-C_6) -环烷基羰基氨基、 (C_1-C_4) -烷基羰基- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CO- (C_1-C_6) -烷基)、 (C_1-C_4) -烷氧基羰基)氨基(-NHCOO- (C_1-C_4) -烷基)、(N- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCONH- (C_1-C_4) -烷基)、(N,N-二- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCON- (C_1-C_4) -二烷基)、(N- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CONH- (C_1-C_4) -烷基)、(N,N-二- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CON- (C_1-C_4) -二烷基)、氨基甲酰基氨基(-NHCONH₂)、(氨基甲酰基)-N- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CONH₂)

[0074] 或特别优选代表苯基、三唑或吡唑，它们各自任选地被相同或不同的取代基单取

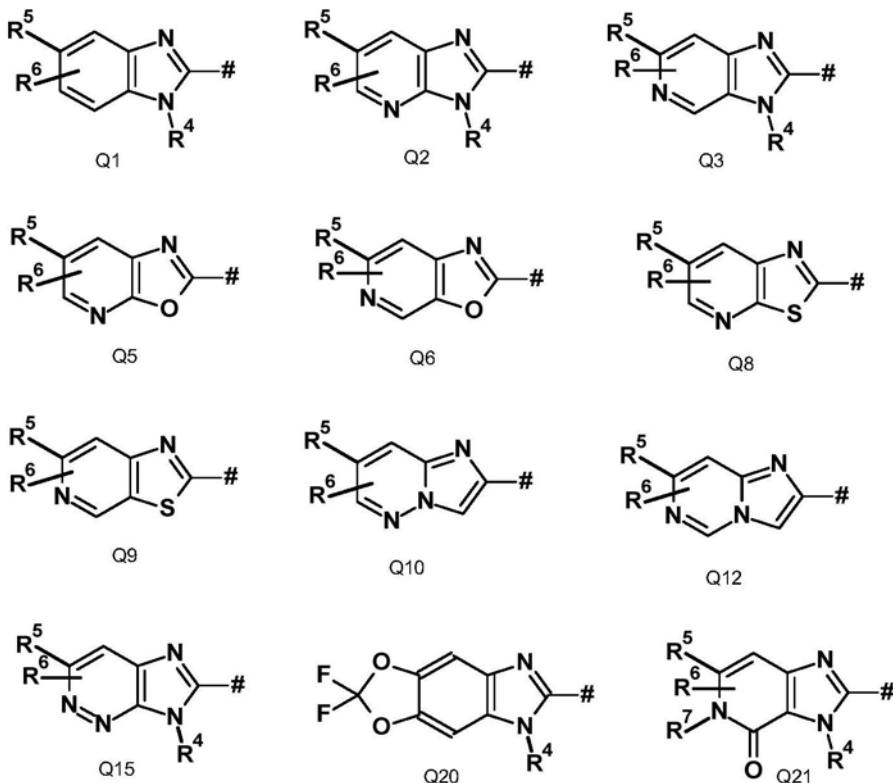
代或二取代,在每种情况下可能的取代基为:氰基、卤素、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基-(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-氰基烷基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-炔基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-烷硫基、(C₁-C₄)-卤代烷硫基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基氧基、(C₁-C₄)-烷基羰基、氨基羰基、(C₁-C₄)-烷基氨基羰基、二-(C₁-C₄)-烷基氨基羰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₄)-烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₄)-烷基氨基磺酰基或(C₁-C₄)-烷基羰基氨基,

[0075] 其中R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷基团中至多两个代表除氢以外的取代基,

[0076] 并且,在R¹¹和R¹⁵、R¹²和R¹⁶或R¹³和R¹⁷均不代表氢的情况下,R¹⁴、R¹⁵、R¹⁶和R¹⁷彼此独立地各自仅代表氰基、卤素、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基-(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基或(C₁-C₄)-卤代烷基,

[0077] 或者,在结构式(In)至(It)的情况下,R¹¹和R¹⁵或R¹³和R¹⁷在每种情况下另外一起特别优选代表氧(=O),

[0078] Q特别优选代表选自Q1、Q2、Q3、Q5、Q6、Q8、Q9、Q10、Q12、Q15、Q20和Q21的杂芳族9元稠合双环体系,



[0080] R⁴特别优选代表(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-氰基烷基或(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基,

[0081] R⁵特别优选代表卤素、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷硫基、(C₁-C₄)-卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基磺酰基或代表任选地被单氰基取代的(C₃-C₆)-环烷基,

[0082] R⁶特别优选代表氢、氰基、卤素或(C₁-C₄)-烷基,

[0083] R⁷特别优选代表氢、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-氰基烷基、(C₁-C₄)-

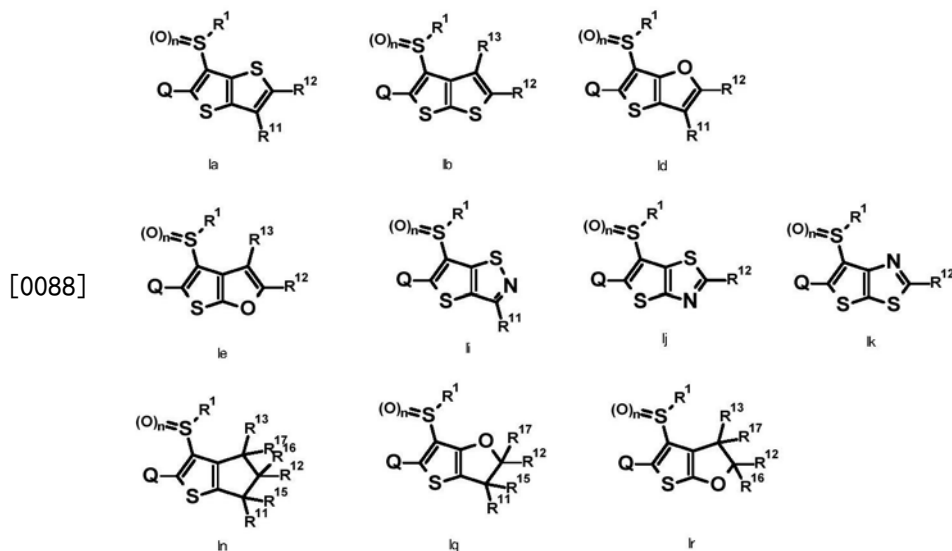
羟基烷基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-烯氧基-(C₁-C₄)-烷基、(C₂-C₄)-卤代烯氧基-(C₁-C₄)-烷基、(C₂-C₄)-卤代烯基、(C₂-C₄)-氰基烯基、(C₂-C₄)-炔基、(C₂-C₄)-卤代炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基-(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷硫基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基-(C₁-C₄)-烷基或(C₁-C₄)-烷基磺酰基-(C₁-C₄)-烷基，

[0084] 和

[0085] n特别优选代表0、1或2。

[0086] 构型4-1

[0087] 非常特别优选式(Ia)、(Ib)、(Id)、(Ie)、(Ii)至(Ik)、(In)、(Iq)和(Ir)的化合物：



[0089] 其中

[0090] R¹非常特别优选代表(C₁-C₄)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基或(C₁-C₄)-卤代烷基，

[0091] R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷彼此独立地非常特别优选代表氢、卤素、(C₁-C₄)-卤代烷基或(C₁-C₄)-烷基，

[0092] R¹¹、R¹²彼此独立地非常特别优选代表氢、氰基、卤素、硝基、羟基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基-(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基、(C₁-C₄)-烷硫基、(C₁-C₄)-卤代烷硫基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基磺酰基、氨基磺酰基、(C₁-C₄)-烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₄)-烷基氨基磺酰基、氨基羰基、(C₁-C₄)-烷基氨基羰基、二-(C₁-C₄)-烷基氨基羰基、(C₃-C₆)-环烷基氨基羰基、(C₁-C₄)-烷基羰基氨基(-NHCO-(C₁-C₄)-烷基)、(C₃-C₆)-环烷基羰基氨基、(C₁-C₄)-烷基羰基-(C₁-C₄)-烷基氨基(-N-(C₁-C₄)-烷基-CO-(C₁-C₆)-烷基)、((C₁-C₄)-烷氧基羰基)氨基(-NHCOO-(C₁-C₄)-烷基)、(N-(C₁-C₄)-烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCONH-(C₁-C₄)-烷基)、(N,N-二-(C₁-C₄)-烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCON-(C₁-C₄)-二烷基)、(N-(C₁-C₄)-烷基氨基甲酰基)-(C₁-C₄)-烷基氨基(-N(C₁-C₄)-烷基-CONH-(C₁-C₄)-烷基)、氨基甲酰基氨基(-NHCONH₂)、(氨基甲酰基)-N-(C₁-C₄)-烷基氨基(-N-(C₁-C₄)-烷基-CONH₂)或非常特别优选代表苯基、吡唑或三唑，它们各自任选地被相同或不同的取代基单取代或二取代，在每种情况下可能的取代基为：氰基、卤素、(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基-(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-

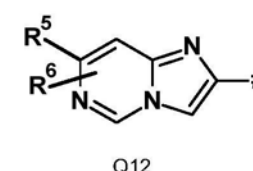
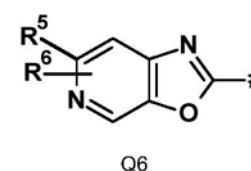
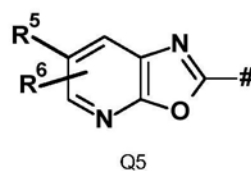
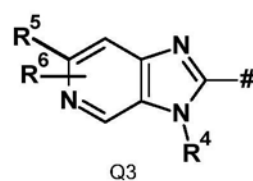
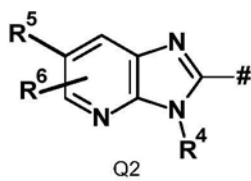
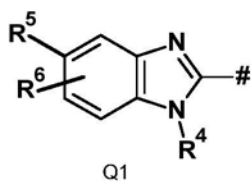
C_6)-环烷基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -烷硫基、 (C_1-C_4) -卤代烷硫基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基氧基、氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基羰基氨基，

[0093] 其中 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 基团中至多两个代表除氢以外的取代基，

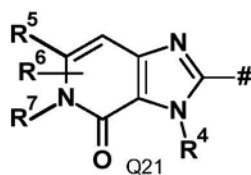
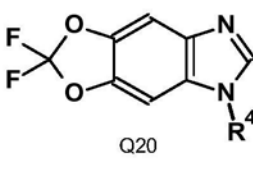
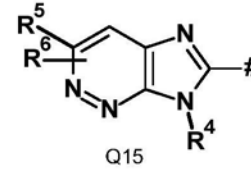
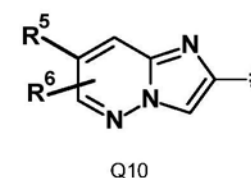
[0094] 并且，在 R^{11} 和 R^{15} 、 R^{12} 和 R^{16} 或 R^{13} 和 R^{17} 均不代表氢的情况下， R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 和 R^{17} 彼此独立地各自仅代表卤素、 (C_1-C_4) -卤代烷基或 (C_1-C_4) -烷基，

[0095] 或者，在结构式(In)、(Iq)和(Ir)的情况下， R^{11} 和 R^{15} 或 R^{13} 和 R^{17} 在每种情况下另外一起非常特别优选代表氧(=O)，

[0096] Q非常特别优选代表选自Q1、Q2、Q3、Q5、Q6、Q12、Q10、Q15、Q20和Q21的杂芳族9元稠合双环体系：



[0097]



[0098] 其中

[0099] R^4 非常特别优选代表 (C_1-C_4) -烷基，

[0100] R^5 非常特别优选代表卤素、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷硫基、 (C_1-C_4) -卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基亚磺酰基或代表任选地被单氟取代的 (C_3-C_6) -环烷基，

[0101] R^6 非常特别优选代表氢，

[0102] R^7 非常特别优选代表氢、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -氰基烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -卤代烯基、 (C_2-C_4) -氰基烯基、 (C_2-C_4) -炔基、 (C_2-C_4) -卤代炔基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基- (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷硫

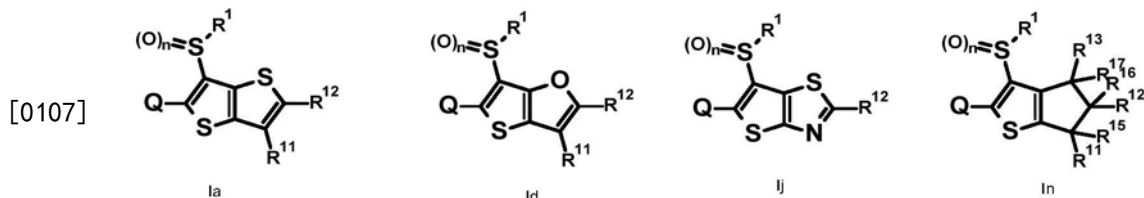
基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) -烷基或 (C_1-C_4) -烷基磺酰基- (C_1-C_4) -烷基，

[0103] 和

[0104] n 甚至更优选为0、1或2。

[0105] 构型5-1

[0106] 重点是式(Ia)、(Id)、(Ij)和(In)的化合物，



[0108] 其中

[0109] R^1 最优选代表 (C_1-C_4) -烷基，

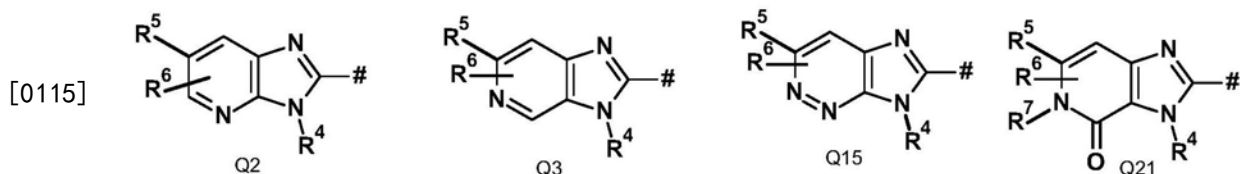
[0110] R^{13} 最优选代表氢或卤素，

[0111] R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 最优选代表氢，

[0112] R^{11} 、 R^{12} 彼此独立地最优选代表氢、羟基、氰基、卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基、氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、 (C_3-C_6) -环烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基羰基氨基(-NHC(O)- (C_1-C_4) -烷基)、 (C_3-C_6) -环烷基羰基氨基、(N- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCONH- (C_1-C_4) -烷基)、苯基，或代表吡唑或三唑，它们各自任选地被 (C_1-C_4) -烷基、卤素或 (C_1-C_4) -卤代烷基单取代，

[0113] 或者，在结构式(In)的情况下， R^{11} 和 R^{15} 或 R^{13} 和 R^{17} 在每种情况下另外一起最优选代表氧(=O)，

[0114] Q最优选代表选自Q2、Q3、Q15和Q21的杂芳族9元稠合双环环体系，



[0116] R^4 最优选代表 (C_1-C_4) -烷基，

[0117] R^5 最优选代表 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷硫基、 (C_1-C_4) -卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基亚磺酰基或单氰基取代的环丙基，

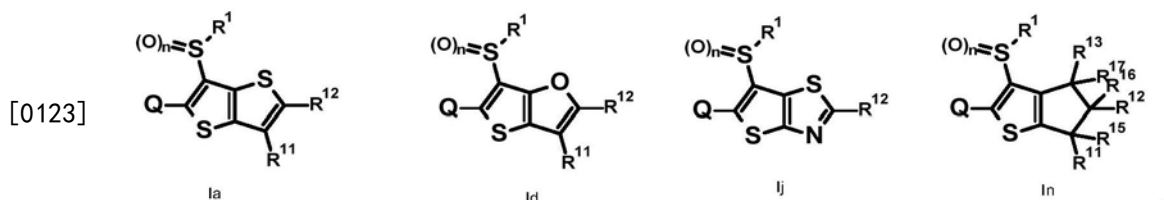
[0118] R^6 最优选代表氢，以及

[0119] R^7 最优选代表 (C_1-C_4) -烷基、环丙基、甲氧基甲基或甲氧基乙基，和

[0120] n 最优选代表0或2。

[0121] 构型6-1

[0122] 重点是式(Ia)、(Id)、(Ij)和(In)的化合物，



[0124] 其中

[0125] R^1 尤其代表乙基,

[0126] R^{13} 尤其代表氢或氟,

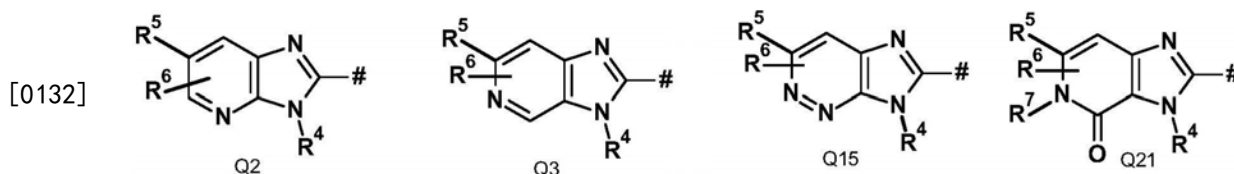
[0127] R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 尤其代表氢,

[0128] R^{11} 尤其代表氢、羟基、氰基、环丙基、三氟甲基、溴、碘、氟、氨基羰基、甲基氨基羰基、甲基羰基氨基、环丙基羰基氨基、(N-甲基氨基甲酰基)氨基 (-NHCONHMe)、苯基、N-甲基吡唑、三氟甲基咪唑或氯吡唑,

[0129] R^{12} 尤其代表氢、环丙基、甲基、三氟甲基或氯,

[0130] 或者,在结构式 (In) 的情况下, R^{11} 和 R^{15} 或 R^{13} 和 R^{17} 在每种情况下另外一起尤其代表氧 (=O),

[0131] Q 尤其代表选自 Q2、Q3、Q15 和 Q21 的杂芳族 9 元稠合双环体系,



[0133] R^4 尤其代表甲基,

[0134] R^5 尤其代表三氟甲基、三氟甲基磺酰基、三氟甲硫基、三氟甲基亚磺酰基或五氟乙基,

[0135] R^6 尤其代表氢,

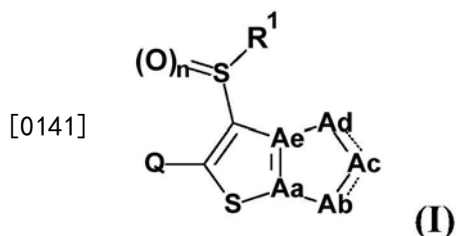
[0136] R^7 尤其代表甲基,

[0137] 和

[0138] n 尤其代表 2。


[0139] 式 (I) 的其他替代实施方案如下所示:

[0140] 式 (I) 的化合物




[0142] 其中  代表两个单键或一个双键和一个单键,

[0143] 其中 (构型 1-2)

[0144] 如果  代表一个双键和一个单键,从而 Aa 至 Ae 形成芳族环,则

[0145] Aa 代表氮或碳,

[0146] Ab 代表氮、氧、硫或 C (R^{11}),

- [0147] Ac代表氮、氧、硫或C(R¹²),
- [0148] Ad代表氮、氧、硫或C(R¹³),
- [0149] Ae代表氮或碳,
- [0150] 其中基团Aa、Ab、Ac、Ad和Ae中至多三个可代表氮并且至多一个可代表氧或至多一个可代表硫,
- [0151] 或者,在仅代表单键的情况下,
- [0152] Aa代表碳,
- [0153] Ab代表硫、氧或C(R¹¹)(R¹⁵),
- [0154] Ac代表硫、氧或C(R¹²)(R¹⁶),以及
- [0155] Ad代表硫、氧或C(R¹³)(R¹⁷),
- [0156] Ae代表碳,
- [0157] 其中基团Aa、Ab、Ac、Ad和Ae中至多一个可代表氧或硫,
- [0158] R¹代表(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基、(C₁-C₆)-氰基烷基、(C₁-C₆)-羟基烷基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-烯氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-卤代烯氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-卤代烯基、(C₂-C₆)-氰基烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₂-C₆)-炔氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-卤代炔氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-卤代炔基、(C₂-C₆)-氰基炔基、(C₃-C₈)-环烷基、(C₃-C₈)-环烷基-(C₃-C₈)-环烷基、(C₁-C₆)-烷基-(C₃-C₈)-环烷基、卤代-(C₃-C₈)-环烷基、氨基、(C₁-C₆)-烷基氨基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基、(C₃-C₈)-环烷基氨基、(C₁-C₆)-烷基羰基氨基、(C₁-C₆)-烷硫基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷硫基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷硫基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基氨基、氨基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基氨基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基,
- [0159] 或代表(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₃-C₈)-环烷基,它们各自任选地被相同或不同的选自芳基、杂芳基和杂环基的取代基单取代或多取代,其中芳基、杂芳基或杂环基可各自任选地被相同或不同的选自以下的取代基单取代或多取代:卤素、氰基、硝基、羟基、氨基、羧基、氨基甲酰基、氨基磺酰基、(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-卤代烷基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基、(C₁-C₆)-烷硫基、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基、(C₁-C₆)-烷基硫亚氨基、(C₁-C₆)-烷基硫亚氨基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基硫亚氨基-(C₂-C₆)-烷基羰基、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基氨基、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基氨基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基氨基-(C₂-C₆)-烷基羰基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基、(C₁-C₆)-烷基羰基、(C₃-C₆)-三烷基甲硅烷基和苄基,或
- [0160] R¹代表芳基、杂芳基或杂环基,它们各自任选地被相同或不同的选自以下的取代基单取代或多取代:卤素、氰基、硝基、羟基、氨基、羧基、氨基甲酰基、(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₈)-环烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-卤代烷基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基、(C₁-C₆)-烷硫基、

(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基、(C₁-C₆)-烷基硫亚氨基、(C₁-C₆)-烷基硫亚氨基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基硫亚氨基-(C₂-C₆)-烷基羰基、(C₁-C₆)-烷基亚砷亚氨基、(C₁-C₆)-烷基亚砷亚氨基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基亚砷亚氨基-(C₂-C₆)-烷基羰基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基、(C₁-C₆)-烷基羰基、(C₃-C₈)-三烷基甲硅烷基、(=O) (仅在杂环基的情况下) 和 (=O)₂ (仅在杂环基的情况下),

[0161] R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷彼此独立地代表氢、氰基、卤素、硝基、羟基、氨基、三-(C₁-C₆)-烷基甲硅烷基、(C₃-C₈)-环烷基、(C₃-C₈)-环烷基-(C₃-C₈)-环烷基、(C₁-C₆)-烷基-(C₃-C₈)-环烷基、卤代-(C₃-C₈)-环烷基、(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基、(C₁-C₆)-氰基烷基、(C₁-C₆)-羟基烷基、羟基羰基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-卤代烯基、(C₂-C₆)-氰基烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₂-C₆)-卤代炔基、(C₂-C₆)-氰基炔基、(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基、(C₁-C₆)-氰基烷氧基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)-烷基-(C₁-C₆)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)-卤代烷基-(C₁-C₆)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)-烷硫基、(C₁-C₆)-卤代烷硫基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷硫基、(C₁-C₆)-烷硫基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)-卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基、(C₁-C₆)-卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基磺酰基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆)-烷基羰基、(C₁-C₆)-烷基硫代羰基、(C₁-C₆)-卤代烷基羰基、(C₁-C₆)-烷基羰基氧基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆)-烷基氨基羰基、(C₁-C₆)-烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基羰基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基硫代羰基、(C₂-C₆)-烯基氨基羰基、二-(C₂-C₆)-烯基氨基羰基、(C₃-C₈)-环烷基氨基羰基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆)-烷基氨基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基、(C₃-C₈)-环烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆)-烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆)-烷基亚砷亚氨基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆)-烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基硫代羰基、(C₁-C₆)-烷基羰基氨基(-NHCO-(C₁-C₆)-烷基)、(C₃-C₈)-环烷基羰基氨基、(C₁-C₆)-烷基羰基-(C₁-C₆)-烷基氨基(-N(C₁-C₆)-烷基-CO-(C₁-C₆)-烷基)、((C₁-C₆)-烷氧基羰基)氨基(-NHCOO-(C₁-C₆)-烷基)、((C₁-C₆)-烷氧基羰基)-(C₁-C₆)-烷基氨基(-N-(C₁-C₆)-烷基-COO-(C₁-C₆)-烷基)、(C₁-C₆)-烷基氨基甲酰氧基(-OCONH-(C₁-C₆)-烷基)、二-(C₁-C₆)-烷基氨基甲酰氧基(-OCON-(C₁-C₆)-二烷基)、(N-(C₁-C₆)-烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCONH-(C₁-C₆)-烷基)、(N,N-二-(C₁-C₆)-烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCON-(C₁-C₆)-二烷基)、(N-(C₁-C₆)-烷基氨基甲酰基)-(C₁-C₆)-烷基氨基(-N(C₁-C₆)-烷基-CONH-(C₁-C₆)-烷基)、(N,N-二-(C₁-C₆)-烷基氨基甲酰基)-(C₁-C₆)-烷基氨基(-N-(C₁-C₆)-烷基-CON-(C₁-C₆)-二烷基)、氨基甲酰基氨基(-NHCONH₂)、(氨基甲酰基)-N-(C₁-C₆)-烷基氨基(-N-(C₁-C₆)-烷基-CONH₂)、或

[0162] 代表芳基或杂芳基,它们各自任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代,其中(在杂芳基的情况下)可任选地存在至少一个羰基,并且其中在每种情况下可能的取代基如下:氰基、羧基、卤素、硝基、羟基、氨基、三-(C₁-C₆)-烷基甲硅烷基、(C₃-C₈)-环烷基、(C₃-C₈)-环烷基-(C₃-C₈)-环烷基、(C₁-C₆)-烷基-(C₃-C₈)-环烷基、卤代-(C₃-C₈)-环烷基、(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基、(C₁-C₆)-氰基烷基、(C₁-C₆)-羟基烷基、羟基羰基-(C₁-C₆)-烷

氧基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-卤代烯基、(C₂-C₆)-氰基烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₂-C₆)-卤代炔基、(C₂-C₆)-氰基炔基、(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基、(C₁-C₆)-氰基烷氧基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)-烷基-(C₁-C₆)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)-卤代烷基-(C₁-C₆)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)-烷硫基、(C₁-C₆)-卤代烷硫基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷硫基、(C₁-C₆)-烷硫基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)-卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基、(C₁-C₆)-卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基磺酰基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆)-烷基羰基、(C₁-C₆)-卤代烷基羰基、(C₁-C₆)-烷基羰基氧基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆)-烷基氨基羰基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基羰基、(C₂-C₆)-烯基氨基羰基、二-(C₂-C₆)-烯基氨基羰基、(C₃-C₈)-环烷基氨基羰基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆)-烷基氨基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆)-烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆)-烷基亚砷亚氨基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆)-烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基硫代羰基、(C₃-C₈)-环烷基氨基或(C₁-C₆)-烷基羰基氨基，

[0163] 其中R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷基团中仅一个或两个代表除氢以外的取代基，并且，在R¹¹和R¹⁵、R¹²和R¹⁶或R¹³和R¹⁷均不代表氢的情况下，R¹⁵、R¹⁶和R¹⁷彼此独立地各自仅代表氰基、卤素、(C₃-C₈)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基-(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基或(C₁-C₄)-氰基烷基，

[0164] Q代表部分饱和的或饱和的杂环或杂芳族8元、9元、10元、11元或12元稠合双环或三环环体系，其可任选地包含至少一个羰基基团和/或其中所述环体系任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代，其中所述取代基彼此独立地可选自氰基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三-(C₁-C₆)-烷基甲硅烷基、(C₃-C₈)-环烷基、(C₃-C₈)-环烷基-(C₃-C₈)-环烷基、(C₁-C₆)-烷基-(C₃-C₈)-环烷基、卤代-(C₃-C₈)-环烷基、(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基、(C₁-C₆)-氰基烷基、(C₁-C₆)-羟基烷基、羟基羰基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-卤代烯基、(C₂-C₆)-氰基烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₂-C₆)-炔氧基-(C₁-C₄)-烷基、(C₂-C₆)-卤代炔基、(C₂-C₆)-氰基炔基、(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-卤代烯氧基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-氰基烷氧基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)-烷基-(C₁-C₆)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)-卤代烷基-(C₁-C₆)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)-烷硫基、(C₁-C₆)-卤代烷硫基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷硫基、(C₁-C₆)-烷硫基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)-卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基、(C₁-C₆)-卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基磺酰基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆)-烷基羰基、(C₁-C₆)-烷基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基硫代羰基、(C₁-C₆)-卤代烷基羰基、(C₁-C₆)-烷基羰基氧基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆)-烷基氨基羰基、(C₁-C₆)-烷基氨基


基硫代羰基、二- (C_1-C_6) -烷基氨基羰基、二- (C_1-C_6) -烷基氨基硫代羰基、 (C_2-C_6) -烯基氨基羰基、二- (C_2-C_6) -烯基氨基羰基、 (C_3-C_8) -环烷基氨基羰基、 (C_1-C_6) -烷基磺酰基氨基、 (C_1-C_6) -烷基氨基、二- (C_1-C_6) -烷基氨基、氨基磺酰基、 (C_1-C_6) -烷基氨基磺酰基、二- (C_1-C_6) -烷基氨基磺酰基、 (C_1-C_6) -烷基亚砷亚氨基、氨基硫代羰基、 (C_1-C_6) -烷基氨基硫代羰基、二- (C_1-C_6) -烷基氨基硫代羰基、 (C_3-C_8) -环烷基氨基、 $NHCO-$ (C_1-C_6) -烷基 (C_1-C_6) -烷基羰基氨基)，

[0165] 或其中所述取代基彼此独立地可选自苯基和5元或6元杂芳族环，其中苯基和所述环可任选地被相同或不同的选自以下的取代基单取代或多取代： C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_2-C_6 -卤代烯基、 C_2-C_6 -卤代炔基、 C_3-C_6 -卤代环烷基、卤素、 CN 、 NO_2 、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基，和

[0166] n 代表0、1或2。

[0167] 构型2-2

[0168] 式(I)的化合物，其中优选地，

[0169] 在  代表一个单键和一个双键，从而Aa至Ae形成芳族环的情况下，

[0170] Aa代表氮或碳，


[0171] Ab代表氮、氧、硫或 $C(R^{11})$ ，

[0172] Ac代表氮、氧、硫或 $C(R^{12})$ ，

[0173] Ad代表氮、氧、硫或 $C(R^{13})$ ，

[0174] Ae代表氮或碳，

[0175] 其中基团Aa、Ab、Ac、Ad和Ae中至多三个可代表氮并且至多一个可代表氧或至多一个可代表硫，

[0176] 或者，在  仅代表单键的情况下，

[0177] Aa代表碳，

[0178] Ab代表硫、氧或 $C(R^{11})(R^{15})$ ，

[0179] Ac代表硫、氧或 $C(R^{12})(R^{16})$ ，以及

[0180] Ad代表硫、氧或 $C(R^{13})(R^{17})$ ，

[0181] Ae代表碳，

[0182] 其中基团Aa、Ab、Ac、Ad和Ae中至多一个可代表氧或硫，

[0183] R^1 优选代表 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -羟基烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -卤代烯基、 (C_2-C_4) -炔基、 (C_2-C_4) -卤代炔基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷硫基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷硫基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基- (C_1-C_4) -烷基，

[0184] 或代表 (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -炔基、 (C_3-C_6) -环烷基，它们各自任选地被相同或不同的芳基或杂环基取代基单取代或二取代，其中芳基或杂环基可在每一种情况下任选地被相同或不同的卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_3-C_4) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基或 (C_1-C_4) -烷硫基取代基单取代或二取代，

[0185] R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 彼此独立地优选代表氢、氰基、卤素、硝基、羟基、氨基、三- (C_1-C_4) -烷基甲硅烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基- (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -氰基烷

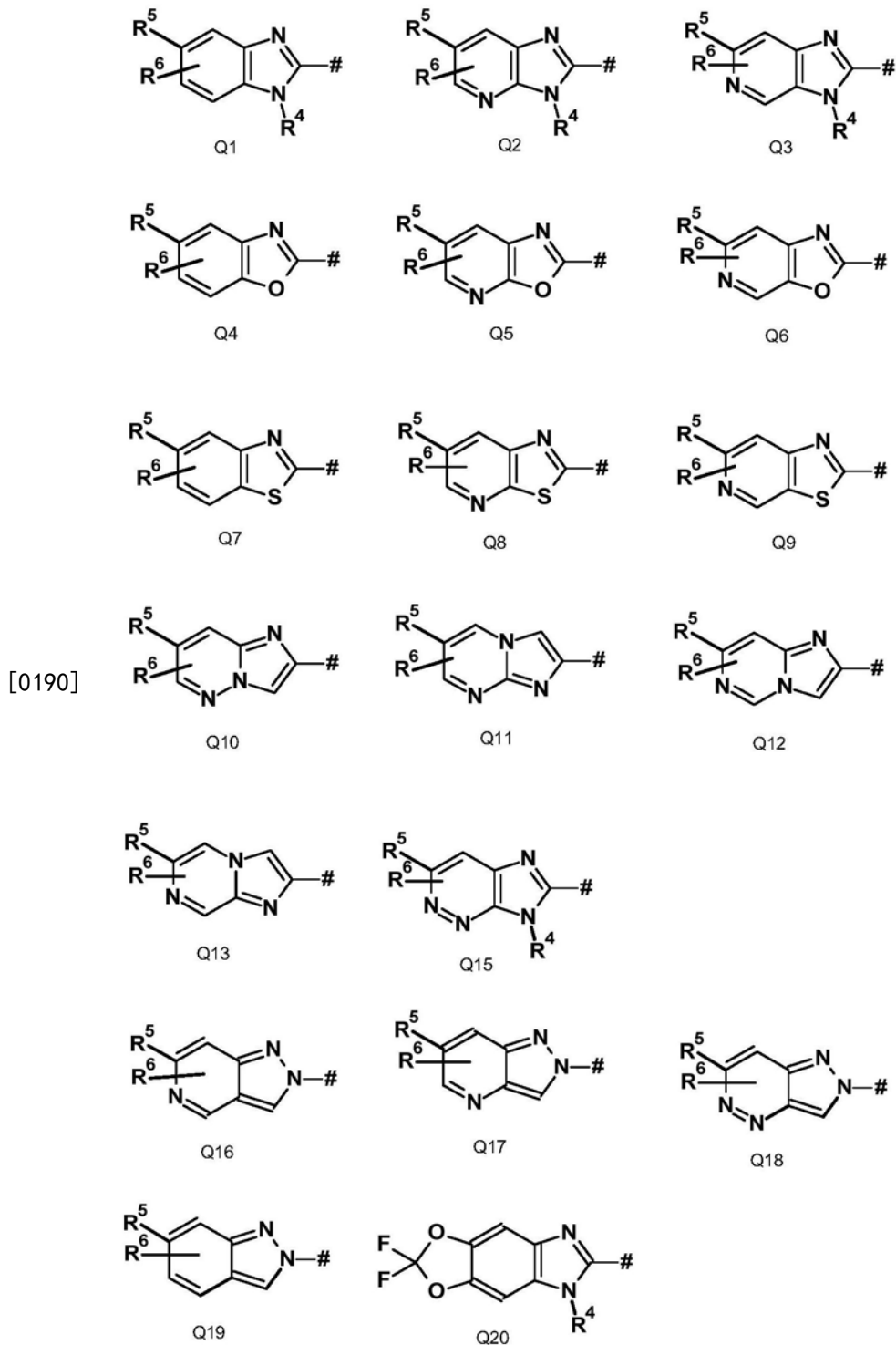
基、(C₁-C₄)-羟基烷基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-卤代烯基、(C₂-C₄)-氰基烯基、(C₂-C₄)-炔基、(C₂-C₄)-卤代炔基、(C₂-C₄)-氰基炔基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基、(C₁-C₄)-氰基烷氧基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-烷基羟基亚氨基、(C₁-C₄)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₄)-烷基-(C₁-C₄)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₄)-卤代烷基-(C₁-C₄)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₄)-烷硫基、(C₁-C₄)-卤代烷硫基、(C₁-C₄)-烷硫基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基氧基、(C₁-C₄)-烷基羰基、(C₁-C₄)-卤代烷基羰基、氨基羰基、氨基硫代羰基、(C₁-C₄)-烷基氨基羰基、二-(C₁-C₄)-烷基氨基羰基、(C₃-C₆)-环烷基氨基羰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基氨基、(C₁-C₄)-烷基氨基、二-(C₁-C₄)-烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₄)-烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₄)-烷基氨基磺酰基、氨基硫代羰基、(C₁-C₄)-烷基羰基氨基、(C₁-C₄)-烷基羰基氨基(-NHC(O)- (C₁-C₄)-烷基)、(C₃-C₆)-环烷基羰基氨基、(C₁-C₄)-烷基羰基-(C₁-C₄)-烷基氨基(-N-(C₁-C₄)-烷基-CO-(C₁-C₆)-烷基)、((C₁-C₄)-烷氧基羰基)氨基(-NHC(OO-(C₁-C₄)-烷基)、((C₁-C₄)-烷氧基羰基)-(C₁-C₄)-烷基氨基(-N-(C₁-C₄)-烷基-COO-(C₁-C₆)-烷基)、(C₁-C₄)-烷基氨基甲酰氧基(-OCONH-(C₁-C₄)-烷基)、二-(C₁-C₄)-烷基氨基甲酰氧基(-OCON-(C₁-C₆)-二烷基)、(N-(C₁-C₄)-烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCONH-(C₁-C₄)-烷基)、(N,N-二-(C₁-C₄)-烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCON-(C₁-C₄)-二烷基)、(N-(C₁-C₄)-烷基氨基甲酰基)-(C₁-C₄)-烷基氨基(-N-(C₁-C₄)-烷基-CONH-(C₁-C₄)-烷基)、(N,N-二-(C₁-C₄)-烷基氨基甲酰基)-(C₁-C₄)-烷基氨基(-N-(C₁-C₄)-烷基-CON-(C₁-C₄)-二烷基)、氨基甲酰基氨基(-NHCONH₂)、(氨基甲酰基)-N-(C₁-C₄)-烷基氨基(-N(C₁-C₄)-烷基-CONH₂)，

[0186] 或优选代表苯基或5元或6元杂芳基，它们各自任选地被相同或不同的取代基单取代或二取代，其中(在杂芳基的情况下)可任选地存在至少一个羰基并且杂原子选自N、S和O，并且其中在每种情况下可能的取代基如下：氰基、卤素、乙酰基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基-(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-氰基烷基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-炔基、(C₂-(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-烷硫基、(C₁-C₄)-卤代烷硫基、(C₁-C₄)-烷硫基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基氧基、(C₁-C₄)-烷基羰基、氨基羰基、(C₁-C₄)-烷基氨基羰基、二-(C₁-C₄)-烷基氨基羰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₄)-烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₄)-烷基氨基磺酰基或(C₁-C₄)-烷基羰基氨基，

[0187] 其中R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷基团中仅一个或两个代表除氢以外的取代基，

[0188] 并且，在R¹¹和R¹⁵、R¹²和R¹⁶或R¹³和R¹⁷均不代表氢的情况下，R¹⁵、R¹⁶和R¹⁷彼此独立地各自仅代表氰基、卤素、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基-(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基或(C₁-C₄)-氰基烷基，

[0189] Q优选代表选自Q1至Q13和Q15至Q20的杂芳族9元或12元稠合双环或三环环体系：



[0191] 其中

[0192] R^4 优选代表 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -氰基烷基、 (C_1-C_4) -羟基烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -烯氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -卤代烯氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -卤代烯基、 (C_2-C_4) -氰基烯基、 (C_2-C_4) -炔基、 (C_2-C_4) -炔氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -卤代炔基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基- (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷硫基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷基磺

酰基- (C_1-C_4) -烷基或 (C_1-C_4) -烷基羰基- (C_1-C_4) -烷基,

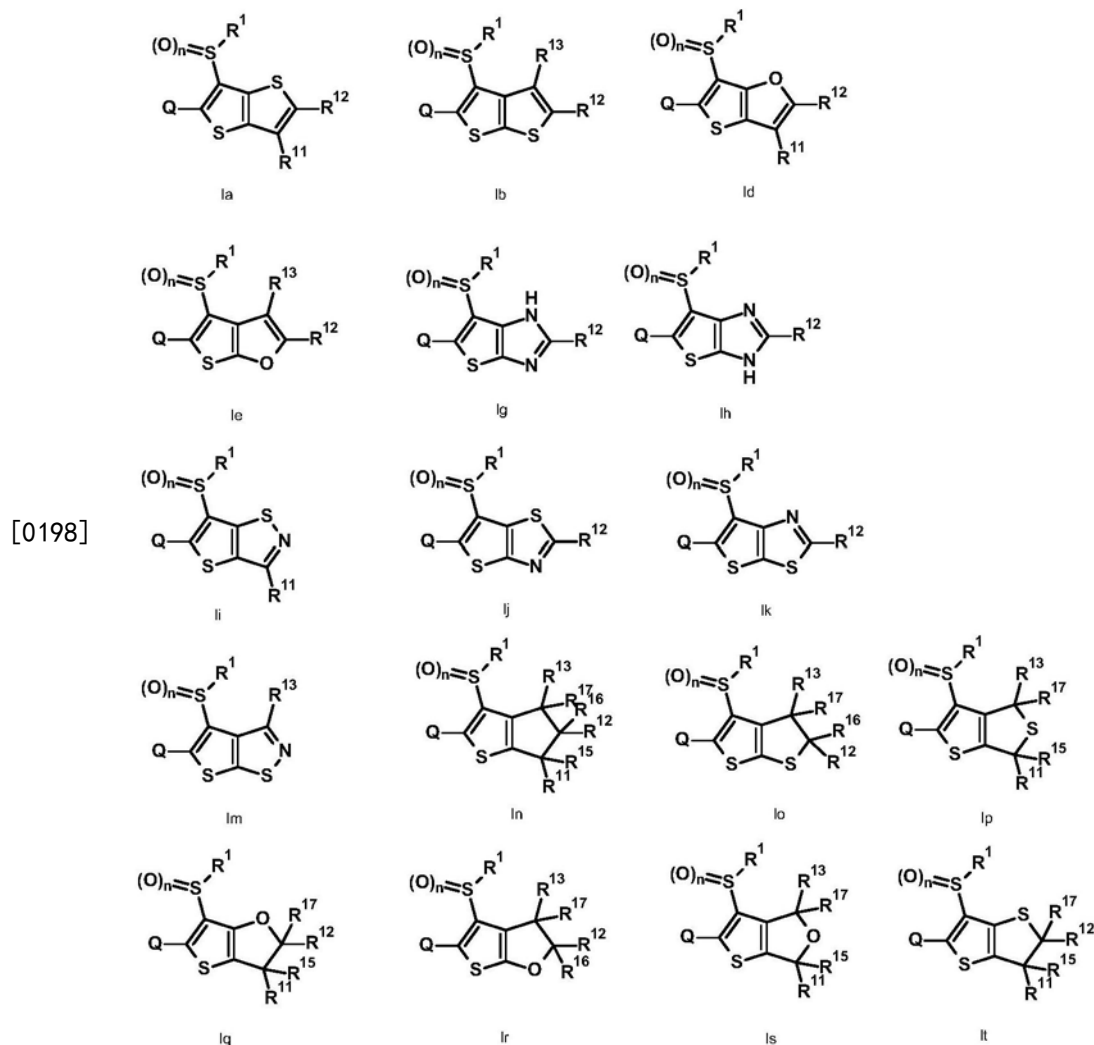
[0193] R^5 、 R^6 彼此独立地优选代表氢、氰基、卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -卤代烯基、 (C_2-C_4) -炔基、 (C_2-C_4) -卤代炔基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷氧基亚氨基、 (C_1-C_4) -烷硫基、 (C_1-C_4) -卤代烷硫基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基氧基、 (C_1-C_4) -烷基羰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基羰基、氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基氨基、 (C_1-C_4) -烷基氨基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基磺酰基或二- (C_1-C_4) -烷基氨基磺酰基,

[0194] 和

[0195] n 优选代表0、1或2。

[0196] 构型3-2

[0197] 式(Ia)、(Ib)、(Id)、(Ie)、(Ig)至(Ik)和(Im)至(It)的化合物,



[0199] 其中

[0200] R^1 特别优选代表 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基或 (C_3-C_6) -环烷基,

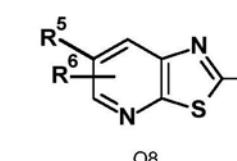
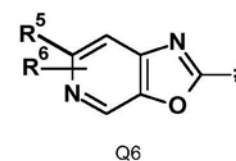
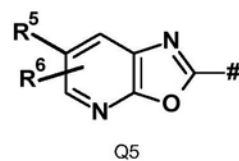
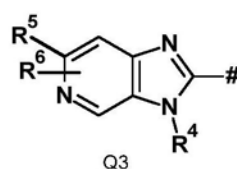
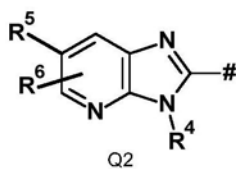
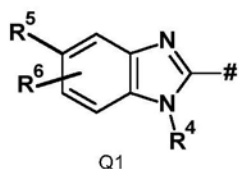
[0201] R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 彼此独立地特别优选代表氢、氰基、卤素、硝基、羟基、 $(C_3-$

C_6)-环烷基、 (C_1-C_4) -烷基- (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷硫基、 (C_1-C_4) -卤代烷硫基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基磺酰基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基磺酰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基磺酰基、氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、 (C_3-C_6) -环烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基羰基氨基(-NHC(O) (C_1-C_4) -烷基)、 (C_3-C_6) -环烷基羰基氨基、 (C_1-C_4) -烷基羰基- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CO- (C_1-C_6) -烷基)、 (C_1-C_4) -烷氧基羰基)氨基(-NHCOO- (C_1-C_4) -烷基)、(N- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCONH- (C_1-C_4) -烷基)、(N,N-二- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCON- (C_1-C_4) -二烷基)、(N- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CONH- (C_1-C_4) -烷基)、(N,N-二- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CON- (C_1-C_4) -二烷基)、氨基甲酰基氨基(-NHCONH₂)、(氨基甲酰基)-N- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CONH₂)，或特别优选代表苯基、三唑或吡唑，它们各自任选地被相同或不同的取代基单取代或二取代，在每种情况下可能的取代基为：氰基、卤素、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基- (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -氰基烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -炔基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -烷硫基、 (C_1-C_4) -卤代烷硫基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基氧基、 (C_1-C_4) -烷基羰基、氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基氨基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基磺酰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基羰基氨基，

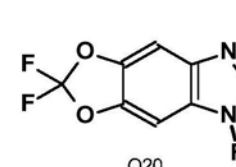
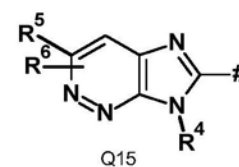
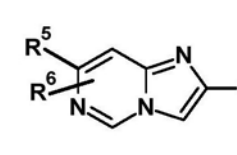
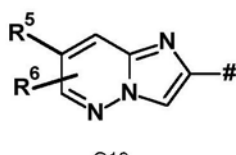
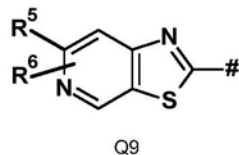
[0202] 其中 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 基团中仅一个或两个代表除氢以外的取代基，

[0203] 并且，在 R^{11} 和 R^{15} 、 R^{12} 和 R^{16} 或 R^{13} 和 R^{17} 均不代表氢的情况下， R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 和 R^{17} 彼此独立地各自仅代表氰基、卤素、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基- (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基或 (C_1-C_4) -卤代烷基，

[0204] Q特别优选代表选自Q1、Q2、Q3、Q5、Q6、Q8、Q9、Q10、Q12、Q15和Q20的杂芳族9元稠合双环体系，



[0205]



[0206] R^4 特别优选代表 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -氰基烷基或 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基，

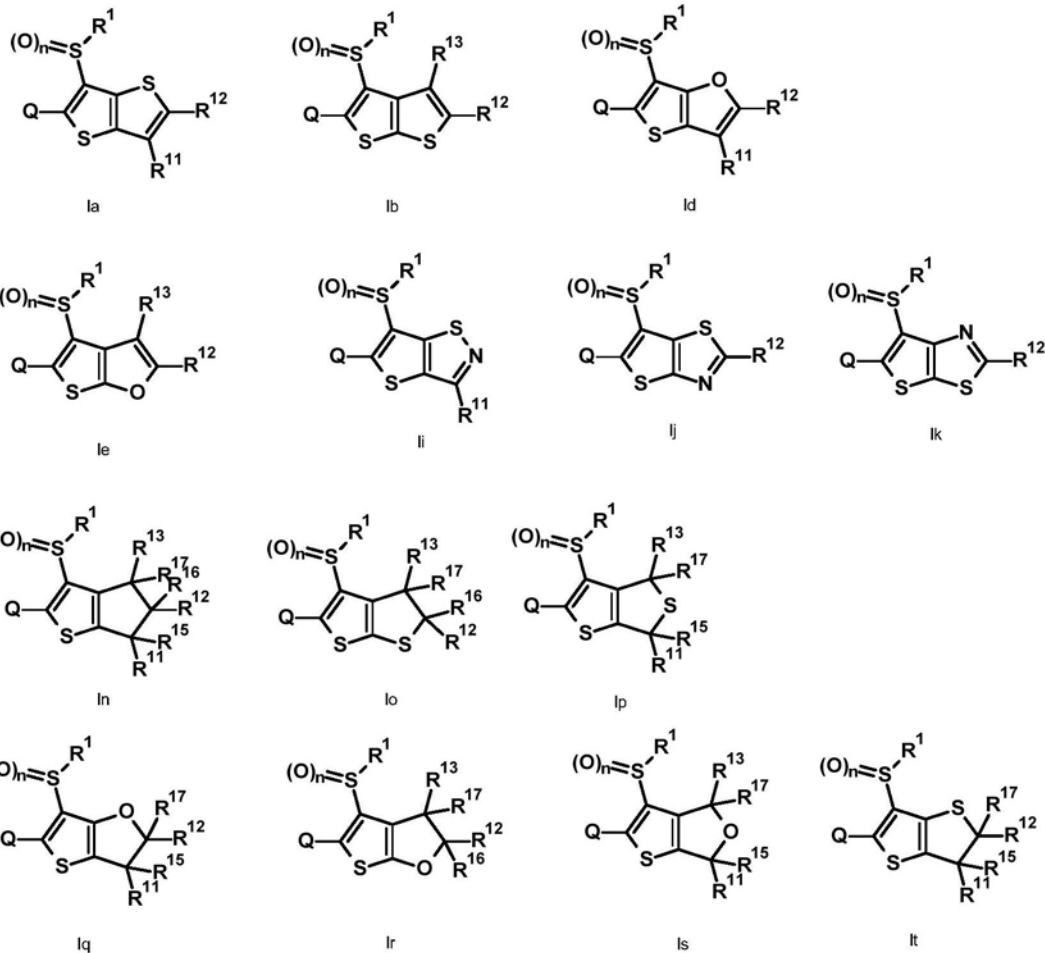
[0207] R^5 特别优选代表卤素、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷硫基、 (C_1-C_4) -卤代烷基亚磺酰基或 (C_1-C_4) -卤代烷基磺酰基，

[0208] R^6 特别优选代表氢、氰基、卤素或 (C_1-C_4) -烷基，和

[0209] n 特别优选代表0、1或2。

[0210] 构型4-2

[0211] 非常特别优选式 (Ia)、(Ib)、(Id)、(Ie)、(Ii) 至 (Ik) 和 (In) 至 (It) 的化合物：



[0212]

[0213] 其中

[0214] R^1 非常特别优选代表 (C_1-C_4) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基或 (C_1-C_4) -卤代烷基，[0215] R^{11} 、 R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 彼此独立地非常特别优选代表氢、卤素、 (C_1-C_4) -卤代烷基或 (C_1-C_4) -烷基，

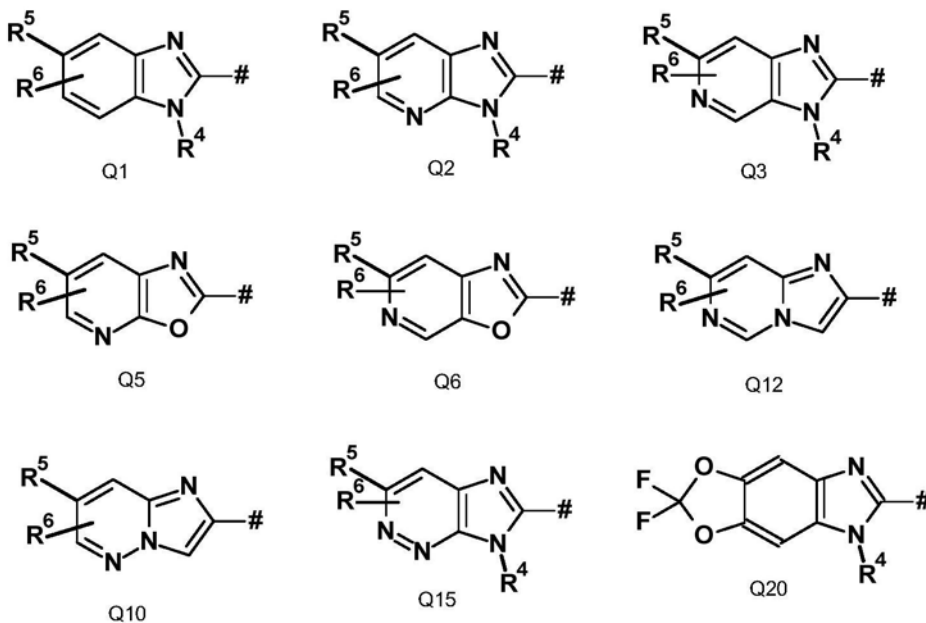
[0216] R^{12} 非常特别优选代表氢、氰基、卤素、硝基、羟基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基- (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷基磺基、 (C_1-C_4) -卤代烷磺基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基磺酰基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基磺酰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基磺酰基、氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、 (C_3-C_6) -环烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基羰基氨基(-NHC(O)- (C_1-C_4) -烷基)、 (C_3-C_6) -环烷基羰基氨基、 (C_1-C_4) -烷基羰基- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CO- (C_1-C_6) -烷基)、((C_1-C_4)-烷氧基羰基)氨基(-NHC(O)- (C_1-C_4) -烷基)、N- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCONH- (C_1-C_4) -烷基)、N,N-二- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCON- (C_1-C_4) -二烷基)、N- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CONH- (C_1-C_4) -烷基)、氨基甲酰基氨基(-NHCONH₂)、(氨基甲酰基)-N- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CONH₂)或非常特别优选代表苯基、吡唑或三唑，它们各自任选地被相同或不同的取代基单取代或二取代，在每种情况下可能的取代基为：氰基、卤素、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基- (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、

(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-烷硫基、(C₁-C₄)-卤代烷硫基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基氧基、氨基羰基、(C₁-C₄)-烷基氨基羰基、二-(C₁-C₄)-烷基氨基羰基、(C₁-C₄)-烷基羰基氨基，

[0217] 其中R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷基团中仅一个或两个代表除氢以外的取代基，

[0218] 并且，在R¹¹和R¹⁵、R¹²和R¹⁶或R¹³和R¹⁷均不代表氢的情况下，R¹⁴、R¹⁵、R¹⁶和R¹⁷彼此独立地各自仅代表卤素、(C₁-C₄)-卤代烷基或(C₁-C₄)-烷基，

[0219] Q非常特别优选代表选自Q1、Q2、Q3、Q5、Q6、Q12、Q10、Q15和Q20的杂芳族9元稠合双环体系：



[0221] 其中

[0222] R⁴非常特别优选代表(C₁-C₄)-烷基，

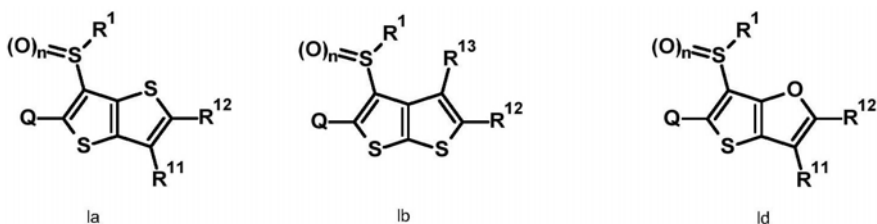
[0223] R⁵非常特别优选代表卤素、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基或(C₁-C₄)-卤代烷硫基，

[0224] R⁶非常特别优选代表氢，和

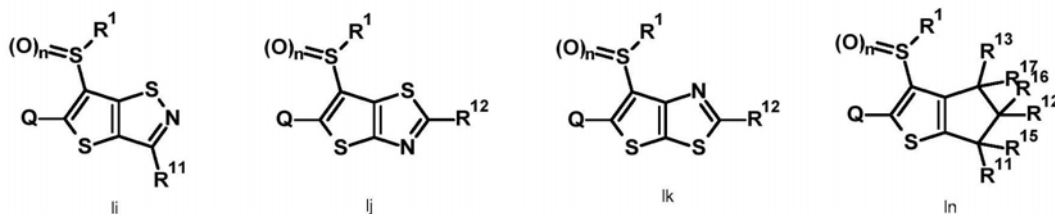
[0225] n非常特别优选代表0、1或2。

[0226] 构型5-2

[0227] 重点是式(Ia)、(Ib)、(Id)、(Ii)、(Ij)、(Ik)和(In)的化合物：



[0228]



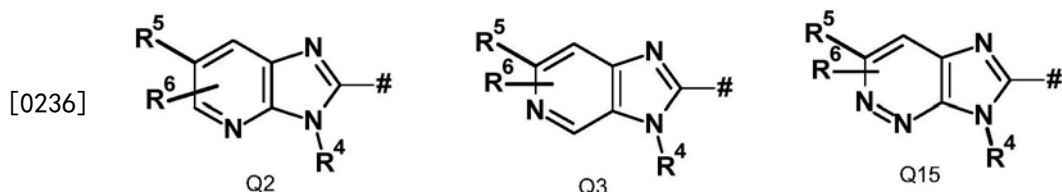
[0229] 其中

[0230] R^1 最优选代表 (C_1-C_4) -烷基,[0231] R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 彼此独立地最优选代表氢,[0232] R^{11} 最优选代表氢、 (C_1-C_4) -烷基或卤素,

[0233] R^{12} 最优选代表氢、卤素、 (C_1-C_4) -烷基、环丙基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基、氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基羰基氨基、 (C_3-C_6) -环烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基羰基氨基(-NHC(O)- (C_1-C_4) -烷基)、环丙基羰基氨基、 (C_1-C_4) -烷基羰基- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CO- (C_1-C_6) -烷基)、 (C_1-C_4) -烷氧基羰基)氨基(-NHCOO- (C_1-C_4) -烷基)、(N- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCONH- (C_1-C_4) -烷基)、氨基甲酰基氨基(-NHCONH₂)、(氨基甲酰基)-N- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CONH₂)

[0234] 或代表苯基、吡唑或三唑,它们各自任选地被相同或不同的卤素单取代或二取代,

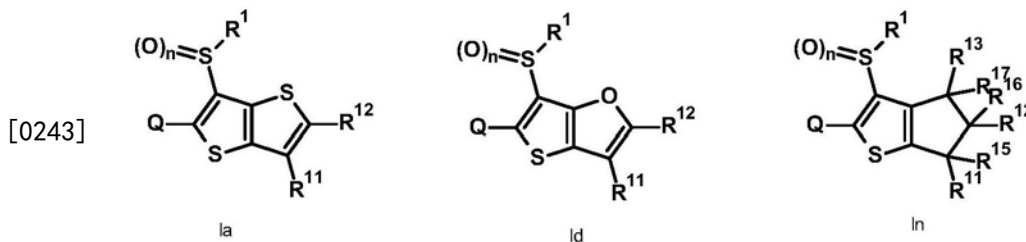
[0235] Q最优选代表选自Q2、Q3和Q15的杂芳族9元稠合双环体系,

[0237] R^4 最优选代表 (C_1-C_4) -烷基,[0238] R^5 最优选代表 (C_1-C_4) -卤代烷基,[0239] R^6 最优选代表氢,和

[0240] n最优选代表0或2。

[0241] 构型6-2

[0242] 特别优选式(Ia)、(Id)、(In)的化合物:



[0244] 其中

[0245] R^1 尤其代表乙基,

[0246] R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 尤其代表氢,

[0247] R^{12} 尤其代表氢或三氟甲基,

[0248] R^{11} 尤其代表氢,

[0249] Q 尤其代表 Q3,

[0250] R^4 尤其代表甲基,

[0251] R^5 尤其代表三氟甲基,

[0252] R^6 尤其代表氢, 和

[0253] n 尤其代表 2。

[0254] 在下文中, 关于式 (I) 的化合物的陈述当然也适用于式 (I) 所包含的式 (Ia)、(Ib)、(Id)、(Ie)、(Ig) 至 (Ik) 和 (Im) 至 (It) 的化合物。

[0255] 在下文中, 表述构型 x 与构型 x-1 或构型 x-2 同义, 其中 x 代表 1、2、3、4、5 或 6。

[0256] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中

[0257] R^1 代表 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基或 (C_3-C_6) -环烷基, 并且

[0258] Aa、Ab、Ac、Ad、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、Q 和 n 具有在构型 (1) 或构型 (2) 或构型 (5) 或构型 (6) 中所述的含义。

[0259] 在一个特别优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中

[0260] R^1 代表 (C_1-C_4) -烷基, 并且

[0261] Aa、Ab、Ac、Ad、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、Q 和 n 具有在构型 (1) 或构型 (2) 或构型 (3) 或构型 (4) 或构型 (6) 中所述的含义。

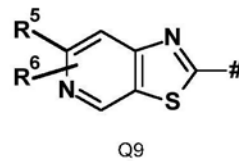
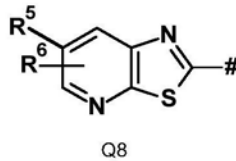
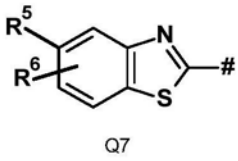
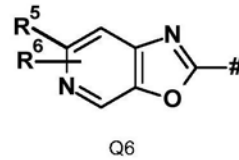
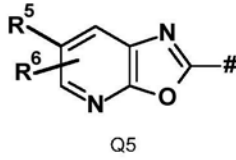
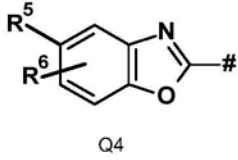
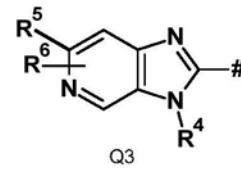
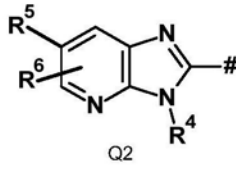
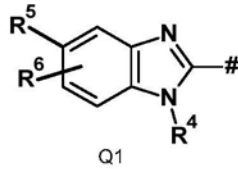
[0262] 在一个非常特别优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中

[0263] R^1 代表乙基, 并且

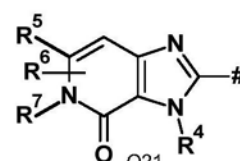
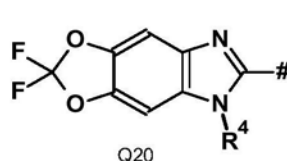
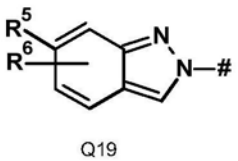
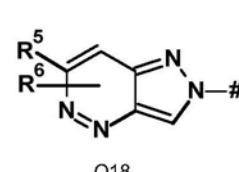
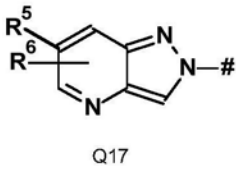
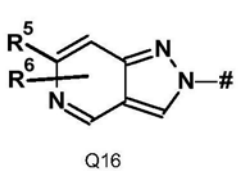
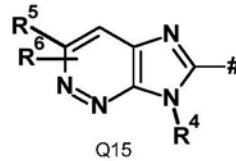
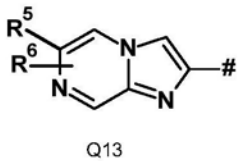
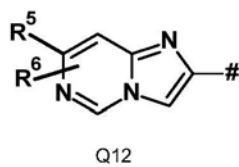
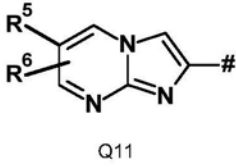
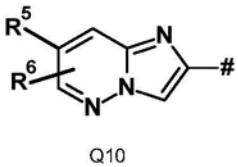
[0264] Aa、Ab、Ac、Ad、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、Q 和 n 具有在构型 (1) 或构型 (2) 或构型 (3) 或构型 (4) 或构型 (5) 中所述的含义。

[0265] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中

[0266] Q 代表选自 Q1 至 Q13 和 Q15 至 Q21 的杂芳族 9 元或 12 元稠合双环或三环体系:



[0267]



[0268] 并且, Aa、Ab、Ac、Ad、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、 R^1 和n具有在构型(1)或构型(3)或构型(4)或构型(5)或构型(6)中所述的含义。

[0269] 在一个特别优选的实施方案中, 本发明涉及式(I)的化合物, 其中

[0270] Q代表选自Q1、Q2、Q3、Q5、Q6、Q8、Q9、Q10、Q12、Q15、Q20和Q21的杂芳族9元或12元稠合双环或三环体系

[0271] 并且, Aa、Ab、Ac、Ad、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、 R^1 和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(4)或构型(5)或构型(6)中所述的含义。

- [0272] 在一个非常特别优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中
- [0273] Q代表选自Q1、Q2、Q3、Q5、Q6、Q12、Q10、Q15、Q20和Q21的杂芳族9元或12元稠合双环或三环体系
- [0274] 并且,Aa、Ab、Ac、Ad、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷、R¹和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(5)或构型(6)中所述的含义。
- [0275] 在一个最优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中
- [0276] Q代表选自Q2、Q3、Q15和Q21的杂芳族9元稠合双环体系
- [0277] 并且,Aa、Ab、Ac、Ad、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷、R¹和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(4)中所述的含义。
- [0278] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中
- [0279] R⁴代表(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-氰基烷基或(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基,并且
- [0280] Aa、Ab、Ac、Ad、R¹、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷、Q和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(4)或构型(5)或构型(6)中所述的含义。
- [0281] 在一个特别优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中
- [0282] R⁴代表(C₁-C₄)-烷基,并且
- [0283] Aa、Ab、Ac、Ad、R¹、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷、Q和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(6)中所述的含义。
- [0284] 在一个非常特别优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中
- [0285] R⁴代表甲基,并且
- [0286] Aa、Ab、Ac、Ad、R¹、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷、Q和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(4)或构型(5)中所述的含义。
- [0287] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中
- [0288] R⁵代表卤素、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷硫基、(C₁-C₄)-卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基磺酰基或代表任选地被单氰基取代的(C₃-C₆)-环烷基,并且
- [0289] Aa、Ab、Ac、Ad、R¹、R⁴、R⁶、R⁷、R⁸、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷、Q和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(4)或构型(5)或构型(6)中所述的含义。
- [0290] 在一个特别优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中
- [0291] R⁵代表卤素、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷硫基、(C₁-C₄)-卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基磺酰基或代表任选地被单氰基取代的(C₃-C₆)-环烷基,并且
- [0292] Aa、Ab、Ac、Ad、R¹、R⁴、R⁶、R⁷、R⁸、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷、Q和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(5)或构型(6)中所述的含义。
- [0293] 在一个非常特别优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中
- [0294] R⁵代表(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-卤代烷硫基、(C₁-C₄)-卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基亚磺酰基或单氰基取代的环丙基,并且
- [0295] Aa、Ab、Ac、Ad、R¹、R⁴、R⁶、R⁷、R⁸、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷、Q和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(4)或构型(6)中所述的含义。

[0296] 在一个特别优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中

[0297] R^5 代表(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基硫基、(C₁-C₄)-卤代烷基磺酰基或(C₁-C₄)-卤代烷基亚磺酰基,并且

[0298] Aa、Ab、Ac、Ad、R¹、R⁴、R⁶、R⁷、R⁸、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷、Q和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(4)或构型(5)或构型(6)中所述的含义。

[0299] 在一个进一步特别优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中

[0300] R^5 代表三氟甲基磺酰基、三氟甲基亚磺酰基、三氟甲基硫基、三氟甲基或五氟乙基,并且

[0301] Aa、Ab、Ac、Ad、R¹、R⁴、R⁶、R⁷、R⁸、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷、Q和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(4)或构型(5)中所述的含义。

[0302] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中

[0303] Q代表选自Q2、Q3、Q15和Q21的杂芳族9元稠合双环体系,

[0304] R⁴代表甲基,

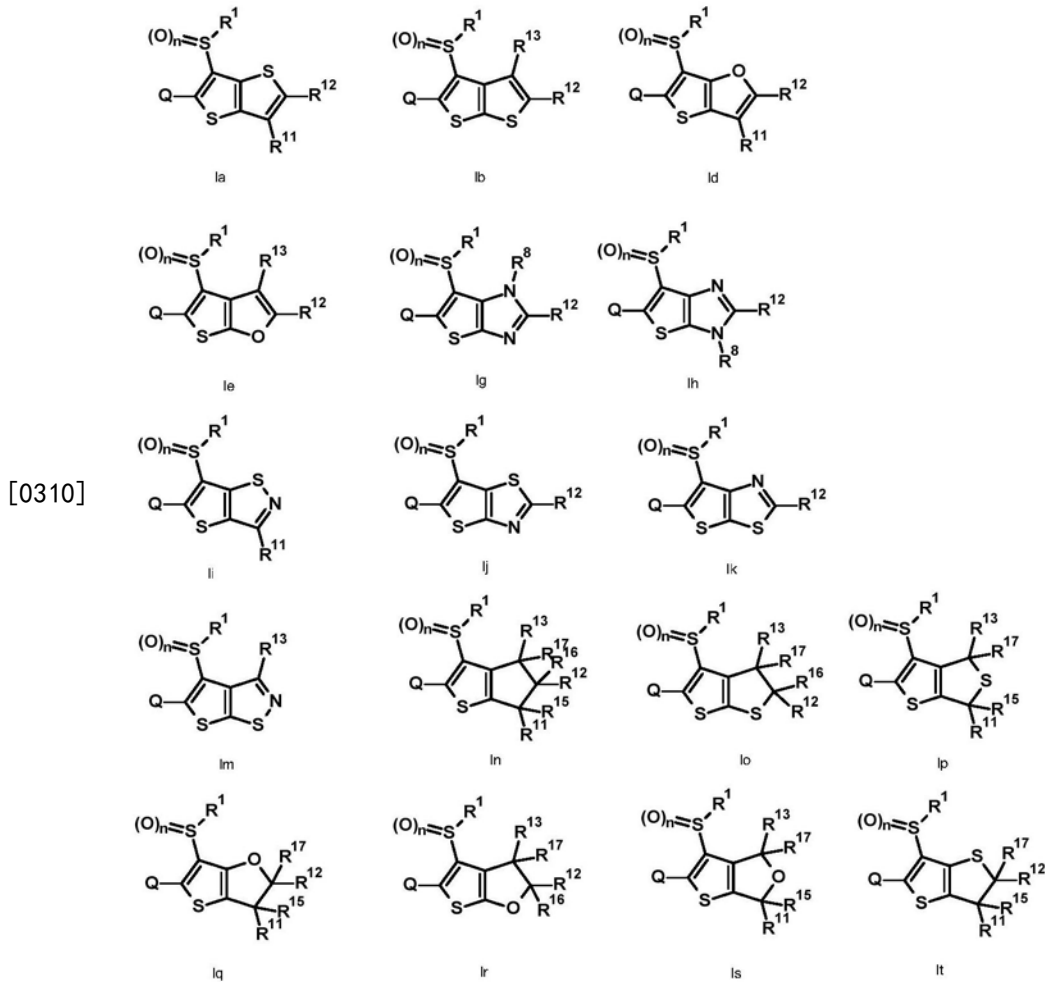
[0305] R^5 代表三氟甲基磺酰基、三氟甲基亚磺酰基、三氟甲基硫基、三氟甲基或五氟乙基,

[0306] R⁶代表氢,

[0307] R⁷代表甲基,并且

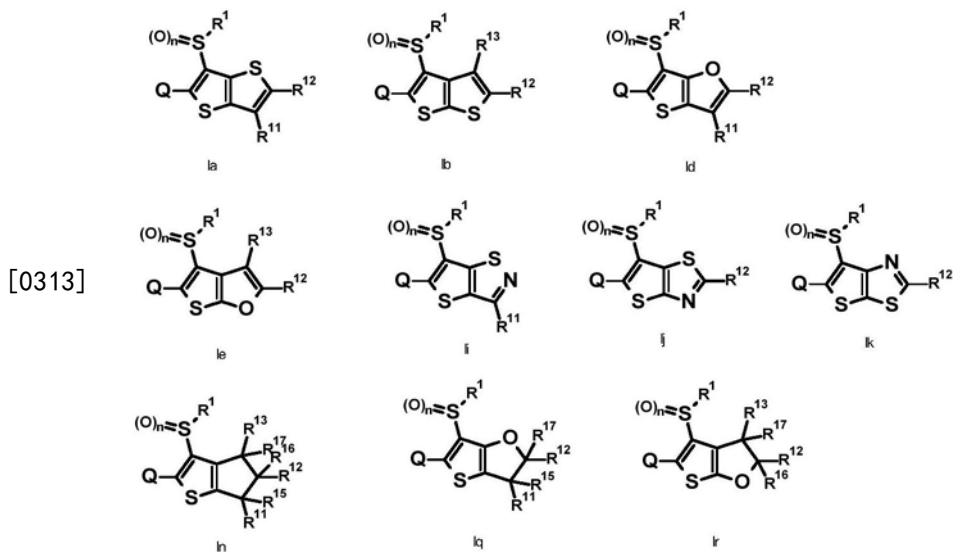
[0308] Aa、Ab、Ac、Ad、R¹、R⁸、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(4)或构型(5)中所述的含义。

[0309] 尤其优选地,下列结构(Ia)、(Ib)、(Id)、(Ie)、(Ig)至(Ik)和(Im)至(It)得自式(I):



[0311] 其中 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、 Q 和 n 具有在构型(1)或构型(2)或构型(4)或构型(5)或构型(6)中所述的含义。

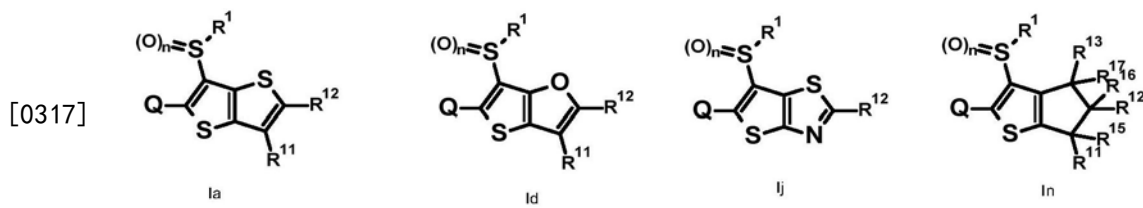
[0312] 尤其优选地,下列结构(Ia)、(Ib)、(Id)、(Ie)、(Ii)至(Ik)、(In)、(Iq)和(Ir)得自式(I):



[0314] 其中 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、 Q 和 n 具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(5)或构型(6)中所述的含义。

[0315] 尤其特别优选地,下列结构得自式(I):

[0316] (Ia)、(Id)、(Ij)和(In),



[0318] 其中 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、Q和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(4)中所述的含义。

[0319] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(Ia)、(Ib)、(Id)、(Ie)、(Ig)至(Ik)和(Im)至(It)的化合物,其中

[0320] R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 彼此独立地代表氢、卤素、 (C_1-C_4) -卤代烷基或 (C_1-C_4) -烷基,

[0321] R^{11} 、 R^{12} 彼此独立地代表氢、氰基、卤素、硝基、羟基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基- (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷基磺基、 (C_1-C_4) -卤代烷基磺基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基磺酰基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基磺酰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基磺酰基、氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、 (C_3-C_6) -环烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基羰基氨基(-NHC(O)- (C_1-C_4) -烷基)、 (C_3-C_6) -环烷基羰基氨基、 (C_1-C_4) -烷基羰基- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CO- (C_1-C_6) -烷基)、(($C_1-C_4)$ -烷氧基羰基)氨基(-NHCOO- (C_1-C_4) -烷基)、N- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCONH- (C_1-C_4) -烷基)、N,N-二- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCON- (C_1-C_4) -二烷基)、N- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CONH- (C_1-C_4) -烷基)、氨基甲酰基氨基(-NHCONH₂)、(氨基甲酰基)-N- (C_1-C_4) -烷基氨基(-N- (C_1-C_4) -烷基-CONH₂)

[0322] 或非常特别优选代表苯基、吡唑或三唑,它们各自任选地被相同或不同的取代基单取代或二取代,在每种情况下可能的取代基为:氰基、卤素、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基- (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -烷基磺基、 (C_1-C_4) -卤代烷基磺基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基氧基、氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基羰基氨基,

[0323] 其中 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 基团中至多两个代表除氢以外的取代基,

[0324] 并且,在 R^{11} 和 R^{15} 、 R^{12} 和 R^{16} 或 R^{13} 和 R^{17} 均不代表氢的情况下, R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 和 R^{17} 彼此独立地各自仅代表卤素、 (C_1-C_4) -卤代烷基或 (C_1-C_4) -烷基,或者,

[0325] 在结构式(In)至(It)的情况下, R^{11} 和 R^{15} 或 R^{13} 和 R^{17} 在每种情况下另外一起非常特别优选代表氧(=O),

[0326] 并且,其中Aa、Ab、Ac、Ad、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、Q和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(5)或构型(6)中所述的含义。

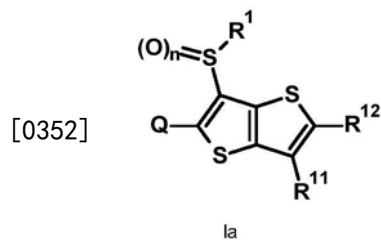
[0327] 在一个特别优选的实施方案中,本发明涉及式(Ia)、(Ib)、(Id)、(Ie)、(Ig)至(Ik)和(Im)至(It)的化合物,其中

- [0328] R^{13} 代表氢或卤素,
- [0329] R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 代表氢,
- [0330] R^{11} 、 R^{12} 彼此独立地代表氢、羟基、氰基、卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基、氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、 (C_3-C_6) -环烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基羰基氨基(-NHCO- (C_1-C_4) -烷基)、 (C_3-C_6) -环烷基羰基氨基、(N- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCONH- (C_1-C_4) -烷基)、苯基,
- [0331] 或代表吡唑或三唑,它们各自任选地被 (C_1-C_4) -烷基、卤素或 (C_1-C_4) -卤代烷基单取代,或者,
- [0332] 在结构式(In)至(It)的情况下, R^{11} 和 R^{15} 或 R^{13} 和 R^{17} 在每种情况下另外一起代表氧(=O),
- [0333] 其中Aa、Ab、Ac、Ad、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、Q和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(4)或构型(6)中所述的含义。
- [0334] 在一个非常特别优选的实施方案中,本发明涉及式(Ia)、(Ib)、(Id)、(Ie)、(Ig)至(Ik)和(Im)至(It)的化合物,其中
- [0335] R^{13} 代表氢或卤素,
- [0336] R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 代表氢,
- [0337] R^{11} 代表氢、羟基、氰基、卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、 (C_3-C_6) -环烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) -烷基羰基氨基(-NHCO- (C_1-C_4) -烷基)、 (C_3-C_6) -环烷基羰基氨基、(N- (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基)氨基(-NHCONH- (C_1-C_4) -烷基)、苯基,
- [0338] 或代表吡唑或三唑,它们各自任选地被 (C_1-C_4) -烷基、卤素或 (C_1-C_4) -卤代烷基单取代,
- [0339] R^{12} 代表氢、卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基或 (C_1-C_4) -卤代烷基,
- [0340] 或者,在结构式(In)至(It)的情况下, R^{11} 和 R^{15} 或 R^{13} 和 R^{17} 在每种情况下另外一起代表氧(=O),
- [0341] 其中Aa、Ab、Ac、Ad、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、Q和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(4)或构型(5)或构型(6)中所述的含义。
- [0342] 在一个同样非常特别优选的实施方案中,本发明涉及式(Ia)、(Ib)、(Id)、(Ie)、(Ig)至(Ik)和(Im)至(It)的化合物,其中
- [0343] R^{13} 代表氢或氟,
- [0344] R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 代表氢,
- [0345] R^{11} 代表氢、羟基、氰基、环丙基、三氟甲基、溴、氟、碘、氨基羰基、甲基氨基羰基、甲基羰基氨基、环丙基羰基氨基、(N-甲基氨基甲酰基)氨基(-NHCONHMe)、苯基、N-甲基吡唑、三氟甲基咪唑或氯吡唑,
- [0346] R^{12} 代表氢、环丙基、甲基、三氟甲基或氯,
- [0347] 或者,在结构式(In)至(It)的情况下, R^{11} 和 R^{15} 或 R^{13} 和 R^{17} 在每种情况下另外一起代表氧(=O),
- [0348] 其中Aa、Ab、Ac、Ad、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、Q和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(4)或构型(5)中所述的含义。

[0349] 在本发明的一个优选的实施方案中,在式(Ia)、(Ib)、(Id)、(Ie)、(Ig)、(Ih)、(Ij)或(Ik)的化合物中, R^{11} 或 R^{12} 基团中至少一个代表与氢不同的基团。

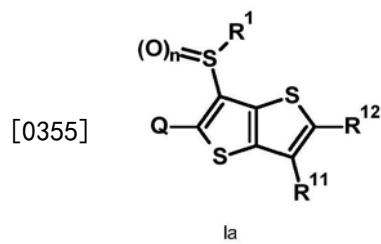
[0350] 此外,优选式I(a)、I(d)和I(j)的化合物,其中 R^{11} 和/或 R^{12} 代表根据构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(4)或构型(5)或构型(6)的基团,但不代表氢,并且其中 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{13} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、Q和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(4)或构型(5)或构型(6)中所述的含义。

[0351] 此外,优选式I(a)的化合物:



[0353] 其中 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、Q和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(4)或构型(5)或构型(6)中所述的含义。

[0354] 特别优选式I(a)的化合物:



[0356] 其中

[0357] R^1 代表(C₁-C₄)-烷基,

[0358] R^{12} 代表氢、(C₁-C₄)-烷基、卤素、(C₃-C₆)-环烷基或(C₁-C₄)-卤代烷基,

[0359] R^{11} 代表氢、氰基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、卤素、氨基羰基、(C₁-C₄)-烷基氨基羰基、(C₁-C₄)-烷基羰基氨基、(C₃-C₆)-环烷基羰基氨基、(N-(C₁-C₄)-烷基氨基甲酰基)、苯基、N-(C₁-C₄)-烷基吡唑、(C₁-C₄)-卤代烷基咪唑或卤代吡唑,

[0360] Q代表Q3、Q15或Q21,

[0361] R^4 代表(C₁-C₄)-烷基,

[0362] R^5 代表(C₁-C₄)-卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基硫基、(C₁-C₄)-卤代烷基或单氰基取代的环丙基,

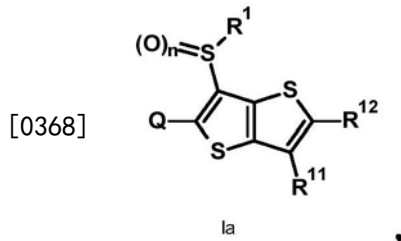
[0363] R^6 代表氢,

[0364] R^7 代表(C₁-C₄)-烷基、环丙基、甲氧基甲基或甲氧基乙基,

[0365] 和

[0366] n代表2。

[0367] 非常特别优选式I(a)的化合物:



[0369] 其中

[0370] R¹代表乙基,

[0371] R¹²代表氢、甲基、氯、环丙基或三氟甲基,

[0372] R¹¹代表氢、氰基、环丙基、三氟甲基、溴、碘、氨基羰基、甲基氨基羰基、甲基羰基氨基、环丙基羰基氨基、(N-甲基氨基甲酰基)氨基(-NHCONHMe)、苯基、N-甲基吡唑、三氟甲基咪唑或氯吡唑,

[0373] Q代表Q3、Q15或Q21,

[0374] R⁴代表甲基,

[0375] R⁵代表三氟甲基磺酰基、三氟甲基亚磺酰基、三氟甲硫基、三氟甲基或五氟乙基,

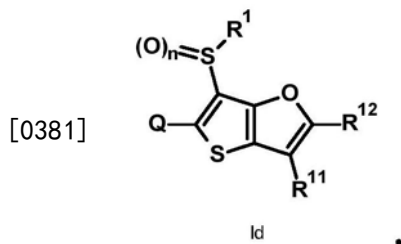
[0376] R⁶代表氢,

[0377] R⁷代表甲基,

[0378] 和

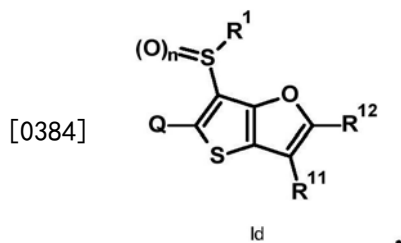
[0379] n代表2。

[0380] 此外,优选式I (d) 的化合物:



[0382] 其中R¹、R⁴、R⁵、R⁶、R¹¹、R¹²、Q和n具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(4)或构型(5)或构型(6)中所述的含义。

[0383] 此外,特别优选式I (d) 的化合物:



[0385] 其中

[0386] R¹代表(C₁-C₄)-烷基,

[0387] R¹²代表氢或(C₁-C₄)-卤代烷基,优选(C₁-C₄)-卤代烷基,

[0388] R¹¹代表氢,

[0389] Q代表Q3,

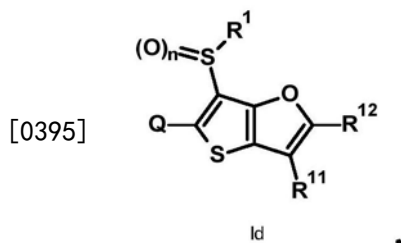
[0390] R^4 代表 (C_1-C_4) -烷基,

[0391] R^5 代表 (C_1-C_4) -卤代烷基,

[0392] R^6 代表氢,和

[0393] n 代表2。

[0394] 此外,非常特别优选式I (d) 的化合物:



[0396] 其中

[0397] R^1 代表乙基,

[0398] R^{12} 代表氢或三氟甲基,优选三氟甲基,

[0399] R^{11} 代表氢,

[0400] Q 代表 Q_3 ,

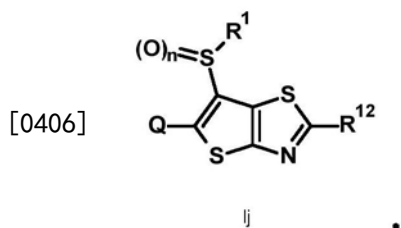
[0401] R^4 代表甲基,

[0402] R^5 代表三氟甲基,

[0403] R^6 代表氢,和

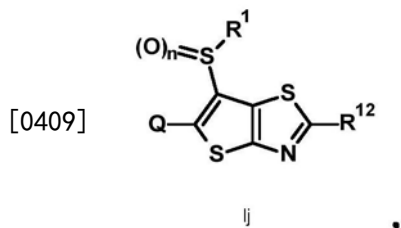
[0404] n 代表2。

[0405] 此外,优选式I (j) 的化合物:



[0407] 其中 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^{12} 、 Q 和 n 具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(4)或构型(5)或构型(6)中所述的含义。

[0408] 此外,特别优选式I (j) 的化合物:



[0410] 其中

[0411] R^1 代表 (C_1-C_4) -烷基,

[0412] R^{12} 代表氢或 (C_1-C_4) -卤代烷基,优选 (C_1-C_4) -卤代烷基,

[0413] Q 代表 Q_2 、 Q_3 或 Q_{15} ,

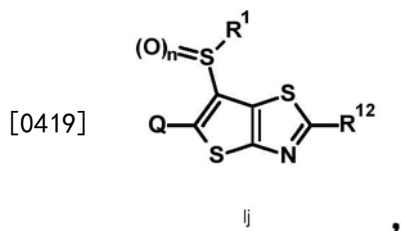
[0414] R^4 代表 (C_1-C_4) -烷基,

[0415] R^5 代表 (C_1-C_4) -卤代烷基,

[0416] R^6 代表氢,和

[0417] n 代表2。

[0418] 此外,非常特别优选式I (j) 的化合物:



[0420] 其中

[0421] R^1 代表乙基,

[0422] R^{12} 代表氢或三氟甲基,优选三氟甲基,

[0423] Q 代表Q2、Q3或Q15,

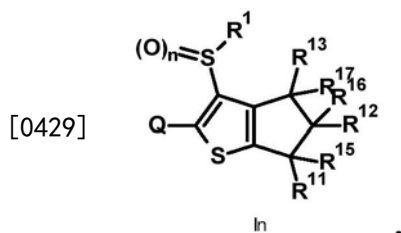
[0424] R^4 代表甲基,

[0425] R^5 代表三氟甲基或五氟乙基,

[0426] R^6 代表氢,和

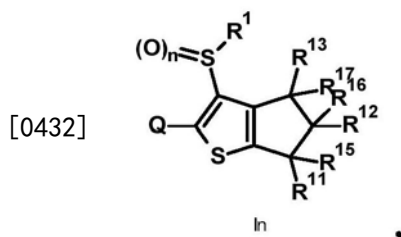
[0427] n 代表2。

[0428] 此外,优选式I (n) 的化合物:



[0430] 其中 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{12} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、 Q 和 n 具有在构型(1)或构型(2)或构型(3)或构型(4)或构型(5)或构型(6)中所述的含义。

[0431] 此外,特别优选式I (n) 的化合物:



[0433] 其中

[0434] R^1 代表 (C_1-C_4) -烷基,

[0435] R^{12} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 代表氢,

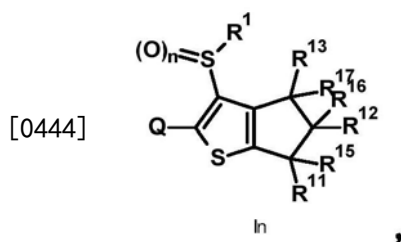
[0436] R^{11} 、 R^{13} 彼此独立地代表氢、羟基或卤素,

[0437] 或者, R^{11} 和 R^{15} 或 R^{13} 和 R^{17} 在每种情况下一起代表=O,

[0438] Q 代表Q3,

[0439] R^4 代表 (C_1-C_4) -烷基,

- [0440] R^5 代表 (C_1-C_4) -卤代烷基，
 [0441] R^6 代表氢，和
 [0442] n 代表2。
 [0443] 此外，非常特别优选式I (n) 的化合物：



- [0445] 其中
 [0446] R^1 代表乙基，
 [0447] R^{12} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 代表氢，
 [0448] R^{11} 、 R^{13} 彼此独立地代表氢、羟基或氟，
 [0449] 或者， R^{11} 和 R^{15} 或 R^{13} 和 R^{17} 在每种情况下一起代表=O，
 [0450] Q代表Q3，
 [0451] R^4 代表甲基，
 [0452] R^5 代表三氟甲基，
 [0453] R^6 代表氢，和
 [0454] n 代表2。

[0455] 根据定义，除非另有说明，卤素选自氟、氯、溴和碘，优选依次选自氟、氯和溴。

[0456] 在本发明的上下文中，除非另有不同定义，术语“烷基”——其本身或与其他术语结合，例如卤代烷基——应理解为意指具有1至12个碳原子且可为支链或无支链的饱和脂族烃基基团。 C_1-C_{12} -烷基基团的实例为甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、正戊基、异戊基、新戊基、叔戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、1-乙基丙基、1,2-二甲基丙基、己基、正庚基、正辛基、正壬基、正癸基、正十一烷基和正十二烷基。

[0457] 根据本发明，除非另有不同定义，术语“烯基”——其本身或与其他术语结合——应理解为意指具有至少一个双键的直链或支链的 C_2-C_{12} -烯基基团，例如乙烯基、烯丙基、1-丙烯基、异丙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1,3-丁二烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1,3-戊二烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基和1,4-己二烯基。

[0458] 根据本发明，除非另有不同定义，术语“炔基”——其本身或与其他术语结合——应理解为意指具有至少一个三键的直链或支链的 C_2-C_{12} -炔基基团，例如乙炔基、1-丙炔基和炔丙基。炔基基团还可含有至少一个双键。

[0459] 根据本发明，除非另有不同定义，术语“环烷基”——其本身或与其他术语结合——应理解为意指 C_3-C_8 -环烷基基团，例如环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基和环辛基。

[0460] 在本发明的情况下，术语“烷氧基”——其本身或与其他术语结合，例如卤代烷氧基——应理解为意指O-烷基基团，其中术语“烷基”如上所定义。

[0461] 卤素取代的基团，例如卤代烷基，为单卤代或多卤代的，最高达可能的取代基的最

大数目。在多卤代的情况下,卤素原子可相同或不同。除非另有说明,任选地取代的基团可为单取代或多取代的,其中在多取代的情况下,取代基可相同或不同。

[0462] 根据本发明,除非另有不同定义,术语“芳基”应理解为意指具有6至14个碳原子的芳族基团,优选苯基、萘基、蒽基或菲基,更优选苯基。

[0463] 除非另有不同定义,术语“芳基烷基”应理解为意指根据本发明定义的基团“芳基”和“烷基”的结合,其中所述基团通常通过烷基连接。其实例为苄基、苯乙基或 α -甲基苄基,特别优选苄基。

[0464] 除非另有不同定义,“杂芳基”表示碳原子和至少一个杂原子的单环、双环或三环杂环基团,其中至少一个环是芳族的。优选地,杂芳基含有3、4、5、6、7或8个碳原子,并且选自:呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡啶基、咪唑基、1,2,3-三唑基、1,2,4-三唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、1,2,3-噁二唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,5-噁二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,2,5-噻二唑基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、1,2,3-三嗪基、1,2,4-三嗪基、1,3,5-三嗪基、苯并呋喃基、苯并异呋喃基、苯并噻吩基、苯并异噻吩基、吡啶基、异吡啶基、吡啶基、苯并噻唑基、苯并异噻唑基、苯并噁唑基、苯并异噁唑基、苯并咪唑基、2,1,3-苯并噁二唑、喹啉基、异喹啉基、噌啉基、酞嗪基、喹唑啉基、喹喔啉基、蔡啶基、苯并三嗪基、嘌呤基、蝶啶基、咪唑并吡啶基和中氮茛基(indoliziny)。

[0465] 除非另有不同定义,“杂环基”表示碳原子和至少一个杂原子的单环的、饱和或部分饱和的4元、5元、6元或7元环,所述至少一个杂原子在所述环中。优选地,杂环基含有3、4、5或6个碳原子和1或2个选自氧、硫和氮的杂原子。杂环基的实例为氮杂环丁烷基、氮杂环戊烷基(azolidinyl)、氮杂环己烷基(azinanyl)、氧杂环丁烷基(oxetanyl)、氧杂环戊烷基(oxolanyl)、氧杂环己烷基(oxanyl)、二氧杂环己烷基(dioxanyl)、硫杂环丁烷基(thietanyl)、硫杂环戊烷基(thiolanyl)、硫杂环己烷基(thianyl)和四氢呋喃基。

[0466] 根据取代基的性质,式(I)的化合物可为几何异构体和/或旋光异构体或不同组成的相应异构体混合物的形式。这些立体异构体为例如对映异构体、非对映异构体、阻转异构体或几何异构体。因此,本发明包括纯的立体异构体和这些异构体的任何所需混合物。

[0467] 式(I)的化合物还可作为盐、特别是酸加成盐和金属盐络合物存在。式(I)的化合物及其酸加成盐和金属盐络合物具有良好的功效,尤其是用于防治动物类有害物的功效。

[0468] 通式(I)的化合物的合适的盐包括常规无毒盐,即与适当的碱的盐和与添加的酸的盐。优选与无机碱的盐,例如碱金属盐,例如钠盐、钾盐或铯盐;碱土金属盐,例如钙盐或镁盐;铵盐;与有机碱的盐和与无机胺的盐,例如三乙基铵盐、二环己基铵盐、N,N'-二苄基乙二铵盐、吡啶鎓盐、甲基吡啶鎓(picolinium)盐或乙醇铵盐;与无机酸的盐,例如盐酸盐、氢溴酸盐、硫酸二氢盐、硫酸三氢盐或磷酸盐;与有机羧酸或有机磺酸的盐,例如甲酸盐、乙酸盐、三氟乙酸盐、马来酸盐、酒石酸盐、甲磺酸盐、苯磺酸盐或对甲苯磺酸盐;与碱性氨基酸的盐,例如精氨酸盐、天冬氨酸盐或谷氨酸盐等。

[0469] 上文以一般性术语给出的或在优选范围内列出的基团定义或说明相应地适用于最终产物以及原料和中间体。这些基团定义可根据需要彼此结合,即包括在各自的优选范围之间的组合。

[0470] 根据本发明优选使用式(I)的化合物,其包含上文作为优选列出的含义的组合。

[0471] 根据本发明特别优选使用式 (I) 的化合物,其包含上文作为特别优选列出的含义的组合。

[0472] 根据本发明非常特别优选使用式 (I) 的化合物,其包含上文作为非常特别优选列出的定义的组合。

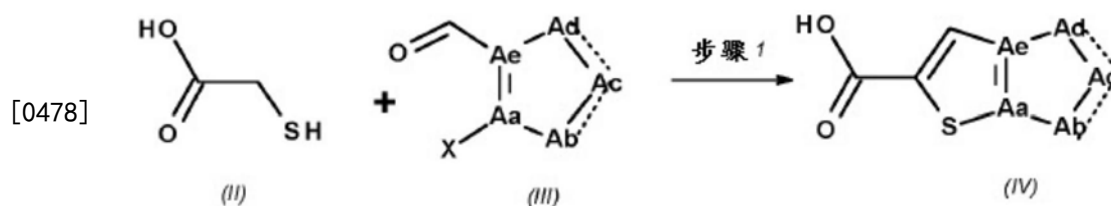
[0473] 根据本发明最优选使用式 (I) 的化合物,其包含上文作为最优选列出的含义的组合。

[0474] 根据本发明尤其使用式 (I) 的化合物,其包含上文作为尤其强调列出的含义的组合。

[0475] 本发明的式 (I) 的化合物可通过下列方案中所示的方法获得:

[0476] 方法A

[0477] 基团Aa、Ab、Ac、Ad、Ae具有上述含义。X代表卤素。



[0479] 步骤1:

[0480] 式 (IV) 的化合物是市售可得的或可通常由巯基乙酸 (II) 和式 (III) 的醛的衍生物制备。适用于该反应的溶剂为,例如,极性溶剂如DMF或二甲基亚砜,或醇类如甲醇或乙醇。反应可通过添加碱如胺碱(例如三乙胺)或无机碱如碳酸钾或甲醇钠进行加速;或可通过其他添加剂如18-冠-6或铜盐进行加速。

[0481] 在Aa代表碳,Ab代表C(R¹¹),Ac代表C(R¹²),Ad代表硫,Ae代表碳的情况下,制备例如类似于WO2008/106019A2,2008进行。

[0482] 在Aa代表碳,Ab代表硫,Ac代表C(R¹²),Ad代表C(R¹³),Ae代表碳的情况下,制备例如类似于Journal of Medicinal Chemistry,1991,第34卷,1805-1818进行。

[0483] 在Aa代表碳,Ab代表C(R¹¹),Ac代表硫,Ad代表C(R¹³),Ae代表碳的情况下,制备例如类似于Chemistry-A European Journal,2016,第22卷,694-703进行。

[0484] 在Aa代表碳,Ab代表C(R¹¹),Ac代表C(R¹²),Ad代表氧,Ae代表碳的情况下,制备例如类似于Collection of Czechoslovak Chemical Communications,1997,第62卷,1468-1480进行。

[0485] 在Aa代表碳,Ab代表氧,Ac代表C(R¹²),Ad代表C(R¹³),Ae代表碳的情况下,制备例如类似于US2003/236263A1,2003进行。


[0486] 在Aa代表碳,Ab代表氮,Ac代表C(R¹²),Ad代表硫,Ae代表碳的情况下,制备例如类似于US2014/200215 A1,2014或WO2015/193506 A1,2015进行。

[0487] 在Aa代表碳,Ab代表氮,Ac代表硫,Ad代表氮,Ae代表碳的情况下,制备例如类似于Journal of Medicinal Chemistry,1998,第41卷,109-116进行。

[0488] 在Aa代表碳,Ab代表硫,Ac代表氮,Ad代表C(R¹³),Ae代表碳的情况下,制备例如类似于Australian Journal of Chemistry,1982,第35卷,393-404进行。

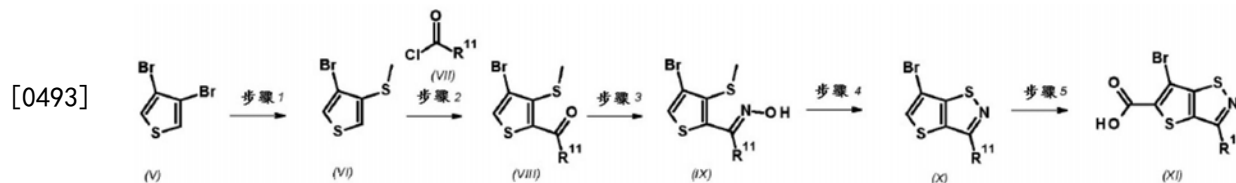
[0489] 在Aa代表碳,Ab代表氮,Ac代表C(R¹²),Ad代表氮,Ae代表碳的情况下,制备例如类

似于W02011/119870 A1,2011进行。

[0490] 在  仅代表单键并且Aa代表碳,Ab代表硫、氧或C(R¹¹)(R¹⁵),Ac代表硫、氧或C(R¹²)(R¹⁶)以及Ad代表硫、氧或C(R¹³)(R¹⁷),Ae代表碳的情况下,制备例如类似于Synthesis, 1992,526-528进行。

[0491] 方法B

[0492] 在Aa代表碳,Ab代表C(R¹¹),Ac代表氮,Ad代表硫,Ae代表碳的情况下,制备例如以五个步骤进行,如Arkivoc,2013,#3,第245-265页中所综述的。



[0494] 步骤1

[0495] 将二溴噻吩(V)用合适的碱如正丁基锂去质子化,然后用硫亲核试剂如二甲基二硫醚清除。

[0496] 步骤2

[0497] 噻吩(VIII)的酰基化是在Friedel-Crafts条件下通过与酰氯(VII)和强路易斯酸如三氯化铝反应而进行。或者,该反应还可以两步通过首先用N-溴代琥珀酰亚胺溴化噻吩(V),然后加入锂碱而进行。在转移金属化之后,锂化的中间体可用合适的亲核试剂如酰氯(VII)清除,从而得到化合物(VIII)。

[0498] 步骤3

[0499] 酮或醛(VIII)可在标准条件下转化为肟(IX)。用于该反应的合适的反应条件为,例如,在醇溶剂如甲醇中加入羟胺和乙酸钠。

[0500] 步骤4

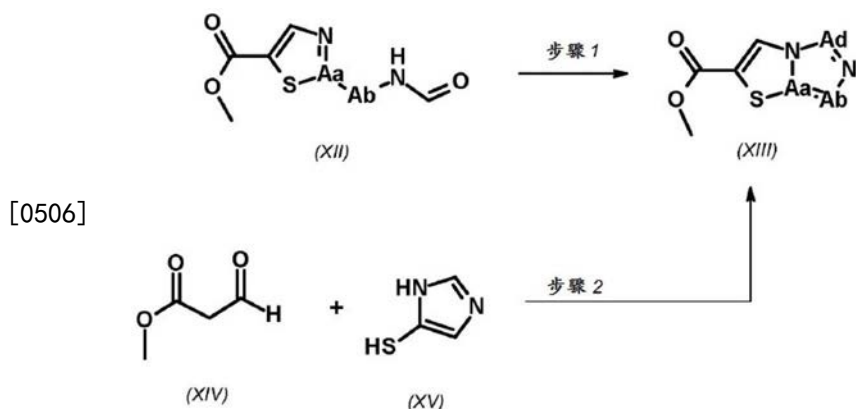
[0501] 分子内环化生成噻吩并异噻唑(thienoisothiazole)(X)在将肟的羟基官能团转化为良好的离去基团后通过在胺碱如三乙胺的存在下,与甲磺酰氯反应而进行。

[0502] 步骤5

[0503] 转化为酸(XI)通过将噻吩并异噻唑(X)用LDA去质子化并用CO₂清除而进行。

[0504] 方法C

[0505] 在Aa代表碳,Ab代表C(R¹¹),Ac代表氮,Ad代表C(R¹³),Ae代表氮的情况下,所需的前体(XIII)例如类似于EP1908766 A1,2008通过在三氯氧磷的存在下环化(XII)而制备(步骤1)。

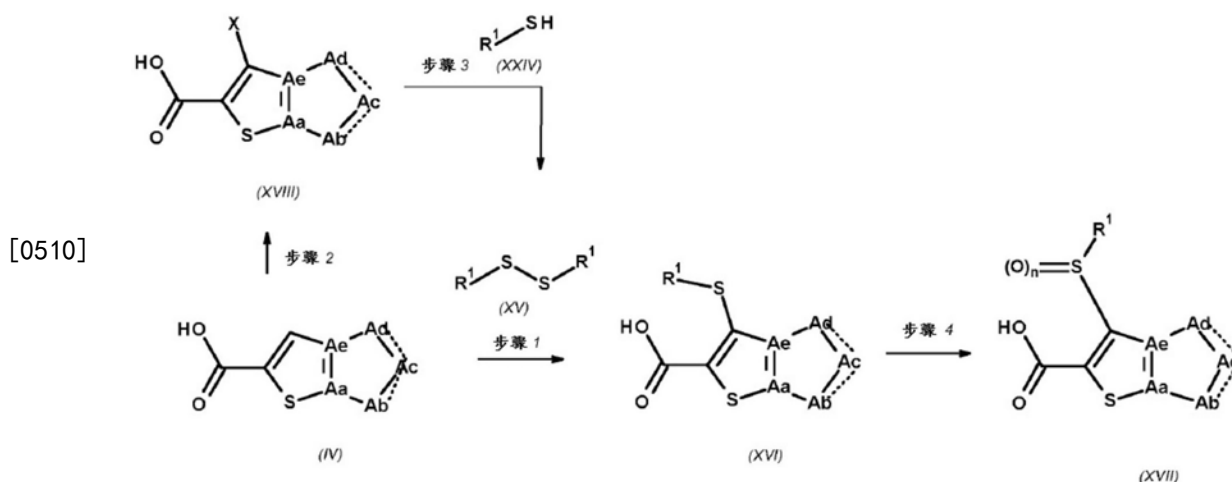


[0506]

[0507] 或者(步骤2),反应还可类似于W02011/37780 A1,2011通过使咪唑(XV)和β-羰基酯(XIV)反应而进行。

[0508] 方法D

[0509] 下面以举例的方式描述制备式(XVII)的化合物的一般方法。X代表卤素,例如氟、氯、溴或碘。



[0511] 步骤1

[0512] (IV)直接转化为硫醚(XVI)可通过使用合适的碱直接邻位锂化,然后使用合适的二硫醚(XV)清除锂化物而进行。对于这种类型的反应,特别合适的碱为,例如,2,2,6,6-四甲基哌啶-1-锂(lithium 2,2,6,6-tetramethylpiperidin-1-ide),或仲丁基锂与N,N,N',N'-四甲基-1,2-二氨基乙烷的组合。这种类型的反应以一般方式记载于例如Organic Letters,2006,第8卷, #4,第765-768页或US2010/48531A1,2010中。

[0513] 步骤2和3

[0514] 或者,转化为硫醚(XVI)可用(IV)起始以两个步骤进行。为此,首先将化合物(IV)在标准条件下在合适的卤化剂的存在下卤化得到(XVIII)。合适的卤化剂为,例如,N-溴代琥珀酰亚胺(参见例如Molecules,2016,1227)或N-氯代琥珀酰亚胺。

[0515] 然后式(XVI)的化合物可通过在碱的存在下使式(XXVIII)的化合物与式(XXIV)的化合物反应而制备。

[0516] 式(XXIV)的硫醇衍生物,例如甲硫醇、乙硫醇或异丙硫醇,可以是市售可得的或可通过已知方法制备,例如类似于US2006/25633、US2006/111591、US2820062、Chemical Communications,13(2000),1163-1164或Journal of the American Chemical Society,

44 (1922), 第1329页中所述的方法制备。

[0517] 转化为式 (XVI) 的化合物可以不用溶剂或在溶剂中进行, 优选在溶剂中进行反应, 所述溶剂选自在主要反应条件下呈惰性的常规溶剂。优选醚, 例如二异丙醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、叔丁基甲基醚; 腈, 例如乙腈或丙腈; 芳族烃, 例如甲苯或二甲苯; 非质子极性溶剂, 例如N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮或二甲基亚砷。

[0518] 合适的碱的实例为无机碱, 其选自碱金属或碱土金属的乙酸盐、磷酸盐和碳酸盐。本文中优选碳酸铯、碳酸钠和碳酸钾。其他合适的碱为碱金属氢化物, 例如氢化钠。

[0519] 该反应可在减压、标准压力或高压下并在0°C至200°C的温度下进行。

[0520] 步骤4

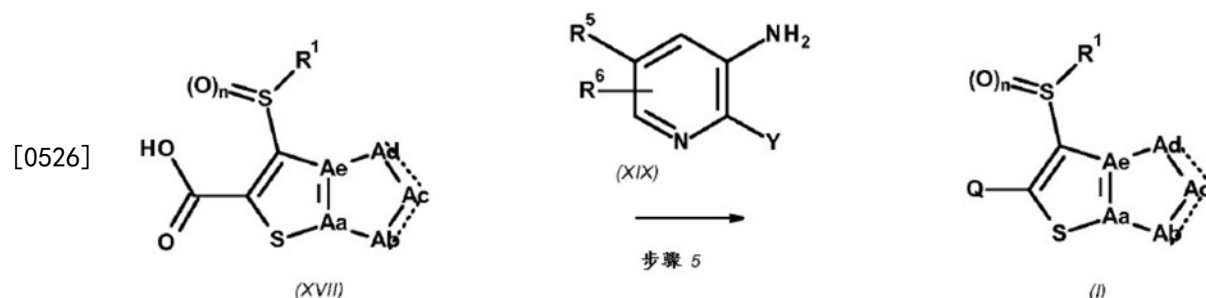
[0521] 式 (XVII) 的化合物, 其中n代表2, 还可以一步法通过氧化式 (XVI) 的化合物而制备。氧化通常在溶剂中进行。优选卤代烃, 例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯; 醇, 例如甲醇或乙醇; 甲酸、乙酸、丙酸或水。

[0522] 合适的氧化剂的实例为过氧化氢和间氯过苯甲酸。

[0523] 该反应可在减压、标准压力或高压下并在-20°C至120°C的温度下进行。

[0524] 方法E

[0525] 制备其中Q代表Q1、Q2、Q3、Q4、Q5、Q6、Q7、Q8、Q9、Q15、Q20或Q21的式 (I) 的化合物的一般方法在下文中例如参考其中Q代表Q2的式 (I) 的化合物进行描述。在Q1、Q2、Q3、Q15、Q20和Q21的情况下, Y代表-NHR₄。在Q4和Q5的情况下, Y代表氯, 或在Q7和Q8的情况下, Y代表SH。



[0527] 式 (I) 的化合物可类似于US5576335中所述的方法通过使式 (XIX) 的化合物与式 (XVII) 的羧酸在缩合剂或碱的存在下反应而制备。

[0528] 式 (XIX) 的化合物可以是市售可得的, 或可通过已知方法制备, 例如类似于US2003/69257、W02006/65703、W02009/131237、W02010/125985、W02011/043404、W02011/040629、W02012/086848、W02013/018928或W02015/000715中所述的方法制备。

[0529] 式 (XVII) 的羧酸可以是市售可得的或可通过已知方法制备。可能的制备途径记载于方法A、B、C和D中。

[0530] 式 (XIX) 的化合物与式 (XVII) 的羧酸的反应可不用溶剂或在溶剂中进行, 优选在溶剂中进行反应, 所述试剂选自在主要反应条件下呈惰性的常规溶剂。优选醚, 例如二异丙醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷; 卤代烃, 例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯; 腈, 例如乙腈或丙腈; 芳族烃, 例如甲苯或二甲苯; 非质子极性溶剂, 例如N,N-二甲基甲酰胺或N-甲基吡咯烷酮; 或氮化合物, 例如吡啶。

[0531] 合适的缩合剂为, 例如, 碳二亚胺, 如1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳二亚胺盐酸盐 (EDCI) 或1,3-二环己基碳二亚胺。

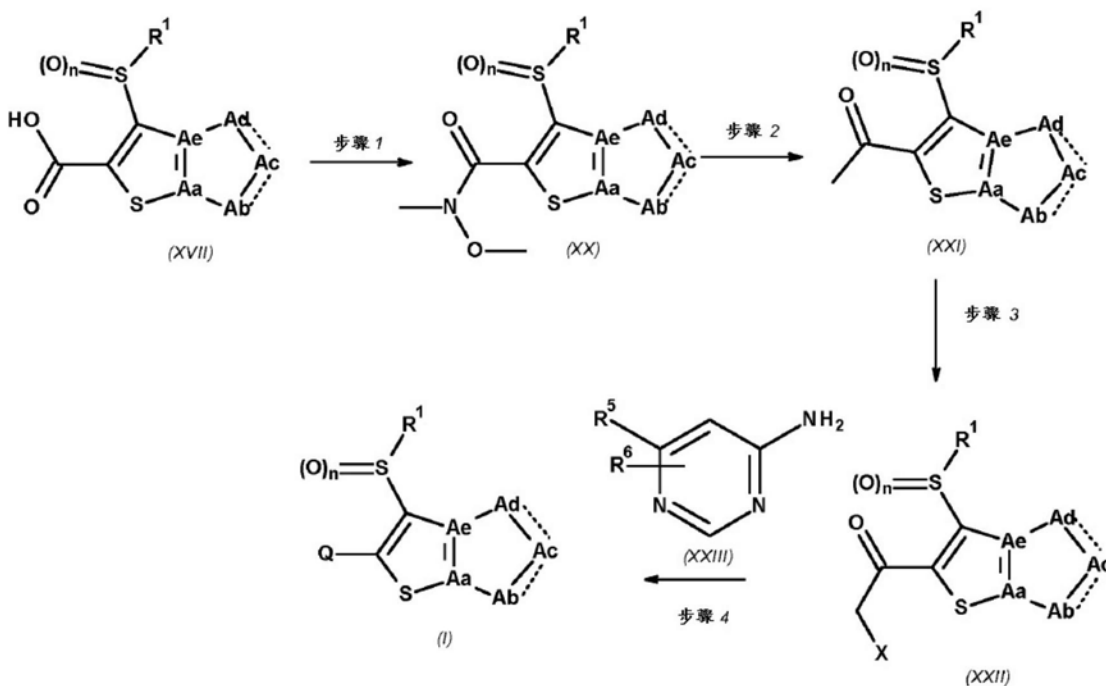
[0532] 合适的碱为通常用于这类反应的无机碱。优选使用选自例如碱金属或碱土金属的乙酸盐、磷酸盐、碳酸盐和碳酸氢盐的碱。本文中特别优选乙酸钠、磷酸钠、磷酸钾、碳酸铯、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠、碳酸氢钾。

[0533] 该反应可在减压、标准压力或高压下并在0°C至180°C的温度下进行；优选地，该反应在标准压力和20至140°C的温度下进行。

[0534] 作为酸 (XVII) 与缩合剂反应的替代方案，所述酸可通过与草酰氯或磷酰氯反应转化为相应的酰氯，然后与 (XIX) 反应。

[0535] 方法F

[0536] 制备其中Q代表Q10、Q11、Q12或Q13的式 (I) 的化合物的一般方法在下文中例如参考其中Q为Q12的式 (I) 的化合物进行描述。



[0537]

[0538] 步骤1

[0539] 式 (XVII) 的羧酸以类似于W02015/107117、W02011/75643或EP2671582中所述的方法在0,N-二甲基羟胺盐酸盐的存在下转化为式 (XX) 的Weinreb酰胺。

[0540] 式 (XVII) 的羧酸是市售可得的或可通过已知方法制备。可能的制备途径记载于方法A、B、C和D中。

[0541] 步骤2、3

[0542] 然后，可以将式 (XX) 的化合物通过已知的方法，例如类似于W02011/75643中所述的方法，使用格氏试剂（例如甲基溴化镁）转化为式 (XXI) 的酮。式 (XXII) 的化合物可通过随后的卤化类似于例如US2012/302573中所述的已知方法而获得。

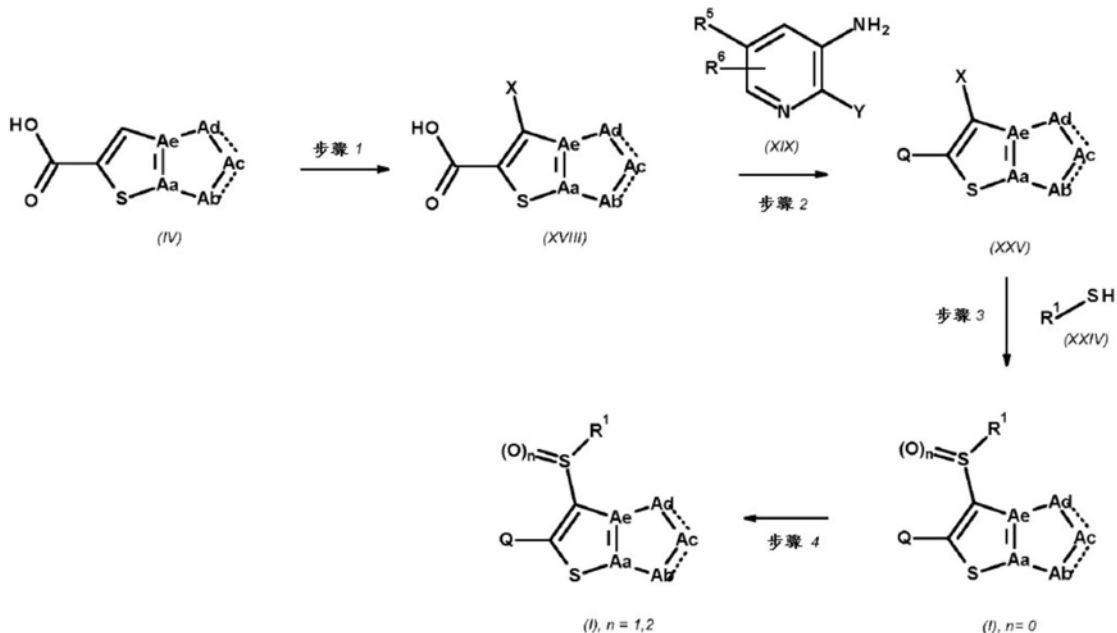
[0543] 步骤4

[0544] 式 (I) 的化合物可通过将式 (XXII) 的化合物用式 (XXIII) 的胺进行环化而制备。所述环化例如在乙醇、乙腈或N,N-二甲基甲酰胺中根据已知方法进行，例如类似于W02005/66177、W02012/88411、W02013/3298、US2009/203705、US2012/258951、W02012/168733、W02014/187762或J. Med. Chem. 31 (1988) 1590-1595中所述的方法进行。

[0545] 式 (XXIII) 的化合物是市售可得的。

[0546] 方法G

[0547] 制备其中Q代表Q1、Q2、Q3、Q4、Q5、Q6、Q7、Q8、Q9、Q15、Q20或Q21的式 (I) 的化合物的一般方法在下文中例如参考其中Q代表Q2的式 (I) 的化合物进行描述。在Q1、Q2、Q3、Q15、Q20和Q21的情况下，Y代表-NHR₄。在Q4和Q5的情况下，Y代表氯，或在Q7和Q8的情况下，Y代表SH。



[0548]

[0549] 步骤1

[0550] 式 XVIII 的化合物可优选通过使用合适的碱对起始物料 (IV) 进行选择金属化，然后与卤化剂反应而制备。

[0551] 合适的碱特别为 2, 2, 6, 6 - 四甲基哌啶基氯化镁 / 氯化锂络合物，如 Chem. Eur. J. 2011, 17, 866-872 中所述。原则上，其他位阻胺碱如二异丙基二乙胺——例如具有其他抗衡离子如锌或锂——也适用于该反应。原则上烷基锂碱如正丁基锂也适合。在这方面，参见，例如 W02005/12311 A1, 2005。

[0552] 合适的卤化剂为，例如，碘、溴、N-溴代琥珀酰亚胺、N-碘代琥珀酰亚胺等。

[0553] 转化可不用溶剂或在溶剂中进行，优选在溶剂中进行反应，所述溶剂选自在主要反应条件下呈惰性的常规溶剂。优选醚，例如乙醚、二异丙醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷；芳族烃，例如甲苯或二甲苯。

[0554] 该反应可以在减压、标准压力或高压下并且在 -78°C 至 100°C 的温度下进行；优选地，该反应在标准压力和 -78°C 至 60°C 的温度下进行。

[0555] 作为上述方法的替代方案，式 (XVII) 的化合物还可通过与卤化剂如溴或 N-溴代琥珀酰亚胺直接反应而转化为 (XVIII)。

[0556] 步骤2

[0557] 式 (XXIV) 的化合物以类似于 US5576335 中所述的方法通过在缩合剂或碱的存在下使式 (XIX) 的化合物与式 (XVIII) 的羧酸反应而制备。

[0558] 式 (XIX) 的化合物是市售可得的或可通过已知方法制备，例如类似于 US2003/69257、W02006/65703、W02009/131237、W02010/125985、W02011/043404、W02011/040629、

W02012/086848、W02013/018928或W02015/000715中所述的方法制备。

[0559] 式 (XVIII) 的羧酸是市售可得的或可通过已知方法制备。可能的制备途径记载于方法A、B、C和D中。

[0560] 式 (XIX) 的化合物与式 (XVIII) 的羧酸的反应可不用溶剂或在溶剂中进行, 优选在溶剂中进行反应, 所述溶剂选自在主要反应条件下呈惰性的常规溶剂。优选醚, 例如二异丙醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷; 卤代烃, 例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯; 腈, 例如乙腈或丙腈; 芳族烃, 例如甲苯或二甲苯; 非质子极性溶剂, 例如N,N-二甲基甲酰胺或N-甲基吡咯烷酮; 或氮化合物, 例如吡啶。

[0561] 合适的缩合剂为, 例如, 碳二亚胺如1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳二亚胺盐酸盐 (EDCI) 或1,3-二环己基碳二亚胺。作为酸 (XVIII) 与缩合剂反应的替代方案, 可将酸通过与草酰氯或磷酰氯反应而转化为相应的酰氯, 然后与 (XIX) 反应。

[0562] 合适的碱为通常用于这类反应的无机碱。优选使用选自例如碱金属或碱土金属的乙酸盐、磷酸盐、碳酸盐和碳酸氢盐的碱。本文中特别优选乙酸钠、磷酸钠、磷酸钾、碳酸铯、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠、碳酸氢钾。

[0563] 该反应可在减压、标准压力或高压下并且在0°C至180°C的温度下进行; 优选地, 该反应在标准压力和20至140°C的温度下进行。

[0564] 步骤3

[0565] 其中n=0的式 (I) 的化合物可通过将 (XXIV) 与适当的硫醇 (XXIV) 偶合而制备。偶合在任选地添加碱的情况下使用由金属盐或金属络合物组成的催化剂和任选的合适的配体而进行。

[0566] 金属盐、金属络合物和配体的合适组合为, 例如, 三-(二亚苄基丙酮) 二钯 (0)、(5-二苄基膦基-9,9-二甲基氧杂蒽-4-基) 二苄基膦 (参见US2009/156642 A1) 或碘化铜 (参见 Australian Journal of Chemistry, 1985, 第38卷, 899)。

[0567] 反应可不用溶剂或在溶剂中进行, 优选在溶剂中进行反应, 所述溶剂选自在主要反应条件下呈惰性的常规溶剂。优选醚, 例如二异丙醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷; 卤代烃, 例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯; 腈, 例如乙腈或丙腈; 芳族烃, 例如甲苯或二甲苯; 非质子极性溶剂, 例如N,N-二甲基甲酰胺或N-甲基吡咯烷酮; 或氮化合物, 例如吡啶。

[0568] 合适的碱为通常用于这类反应的无机碱。优选使用选自例如碱金属或碱土金属的乙酸盐、磷酸盐、碳酸盐和碳酸氢盐的碱。

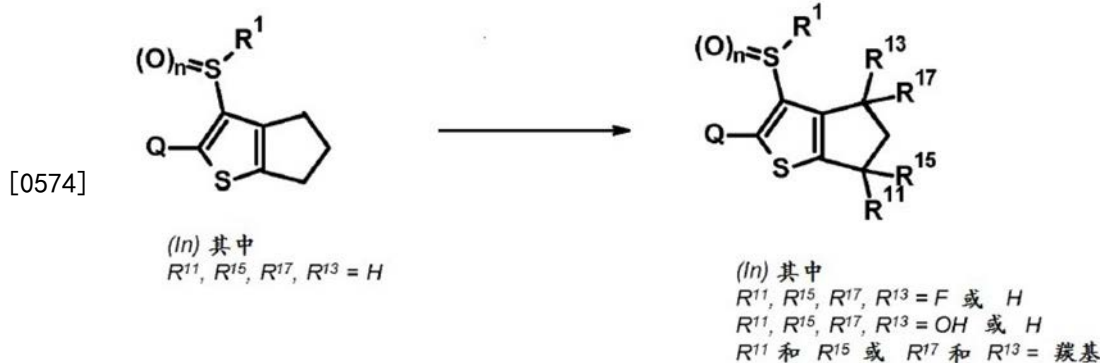
[0569] 步骤4

[0570] 其中n为1或2的式 (I) 的化合物可通过氧化其中n=0的式 (I) 的化合物而制备。氧化通常在溶剂中进行。优选卤代烃, 例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯; 醇, 例如甲醇或乙醇; 甲酸、乙酸、丙酸或水。

[0571] 合适的氧化剂的实例为过氧化氢和间氯过苯甲酸。

[0572] 该反应可在减压、标准压力或高压下并且在-20°C至120°C的温度下进行。

[0573] 方法H:



[0575] 其中 R^{11} 、 R^{15} 、 R^{13} 和 R^{17} 可代表H、OH或F的式(I)的化合物,和其中 R^{11} 和 R^{15} 或 R^{13} 和 R^{17} 可一起代表羰基的化合物都可由其中 R^{11} 、 R^{15} 、 R^{13} 和 $R^{17} = H$ 的式(I)的化合物通过与合适的氟化剂和氧化剂反应而获得。

[0576] 合适的氟化剂为,例如,Selectfluor、NFPy、Accufluor、NFSI,如Chem.Rev.2015,115,9073中所述。合适的氧化剂为过硫酸钾。金属催化和光催化方法同样是可行的,并且记载于例如Chem.Rev.2015,115,9073中。

[0577] 方法和用途

[0578] 本发明还涉及防治动物类有害物的方法,其中使式(I)的化合物作用于动物类有害物和/或其生境。动物类有害物的防治优选在农业和林业以及材料保护中进行。优选排除用于人体或动物体的外科或治疗性治疗的方法以及在人体或动物体上进行的诊断方法。

[0579] 本发明还涉及式(I)的化合物作为农药、尤其是作物保护组合物的用途。

[0580] 在本申请的上下文中,术语“农药”在每种情况下还总是包括术语“植物保护组合物”。

[0581] 鉴于良好的植物耐受性、有利的恒温动物毒性和良好的环境相容性,式(I)的化合物适于保护植物和植物器官抵抗生物和非生物胁迫因素,提高采收量,改善采收物的质量,以及防治在农业、园艺、畜牧业、水产养殖、林业、花园和休闲设施、储存产品和材料的保护以及卫生领域中遇到的动物类有害物,尤其是昆虫、蛛形纲动物、蠕虫,尤其是线虫和软体动物。

[0582] 在本专利申请的上下文中,术语“卫生”应理解为意指旨在预防疾病、尤其是感染性疾病以及用于保护人类和动物健康和/或保护环境和/或保持清洁的任意和所有措施、设备和步骤。根据本发明,这尤其包括对例如纺织品或硬表面,尤其是由玻璃、木材、水泥、瓷、陶瓷、塑料或金属制成的表面进行清洁、消毒和杀菌以确保这些都没有卫生有害物和/或其分泌物的措施。在这点上,本发明的保护范围优选排除应用于人体或动物体的外科或治疗性治疗步骤,以及在人体或动物体上进行的诊断步骤。

[0583] 术语“卫生领域”涵盖其中这些卫生措施、设备和步骤重要的所有区域、技术领域和工业应用,例如关于厨房、面包店、机场、浴室、游泳池、百货公司、旅馆、医院、厩舍、动物饲养等中的卫生。

[0584] 因此,术语“卫生有害物”应理解为意指一种或多种这样的动物类有害物,其在卫生领域中的存在是有问题的,尤其是出于健康原因。因此,一个主要目的是避免卫生领域中卫生有害物的存在和/或与其接触,或将卫生领域中卫生有害物的存在和/或与其接触限制至最小程度。这尤其可通过农药的使用来实现,所述农药既可用于预防侵染也可用于预防

现有侵染。也可使用防止或减少与有害物接触的制剂。卫生有害物包括例如下文所提及的生物。

[0585] 因此,术语“卫生保护”涵盖保持和/或改善这些卫生措施、设备和步骤的所有行为。

[0586] 式(I)的化合物可优选用作农药。它们对通常敏感且具有抗性的物种以及对所有或特定发育阶段均具有活性。上述有害物包括:

[0587] 来自节肢动物门(Arthropoda)、特别是蛛形纲(Arachnida)的有害物,例如粉螨属(*Acarus* spp.),例如粗脚粉螨(*Acarus siro*),枸杞瘿螨(*Aceria kuko*)、柑橘瘤瘿螨(*Aceria sheldoni*),刺皮瘿螨属(*Aculops* spp.),针刺瘿螨属(*Aculus* spp.),例如福氏刺皮瘿螨(*Aculus fockeui*)、苹果刺锈螨(*Aculus schlechtendali*),花蜱属(*Amblyomma* spp.),山楂叶螨(*Amphitetranychus viennensis*),锐缘蜱属(*Argas* spp.),牛蜱属(*Boophilus* spp.),短须螨属(*Brevipalpus* spp.),例如紫红短须螨(*Brevipalpus phoenicis*),*Bryobia graminum*、苜蓿苔螨(*Bryobia praetiosa*),刺尾蝎属(*Centruroides* spp.),皮螨属(*Chorioptes* spp.),鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*),屋尘螨(*Dermatophagoides pteronyssinus*)、粉尘螨(*Dermatophagoides farinae*),革蜱属(*Dermacentor* spp.),始叶螨属(*Eotetranychus* spp.),例如*Eotetranychus hicoriae*,梨上瘿螨(*Epitrimerus pyri*),真叶螨属(*Eutetranychus* spp.),例如*Eutetranychus banksi*,瘿螨属(*Eriophyes* spp.),例如梨瘿螨(*Eriophyes pyri*),家食甜螨(*Glycyphagus domesticus*),红腿地螨(*Halotydeus destructor*),半跗线螨属(*Hemitarsonemus* spp.),例如茶半跗线螨(*Hemitarsonemus latus*) (=侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonemus latus*)),璃眼蜱属(*Hyalomma* spp.),硬蜱属(*Ixodes* spp.),寇蛛属(*Latrodectus* spp.),斜蛛属(*Loxosceles* spp.),*Neutrombicula autumnalis*,*Nuphessa* spp.,小爪螨属(*Oligonychus* spp.),例如咖啡小爪螨(*Oligonychus coffeae*)、*Oligonychus coniferarum*、冬青小爪螨(*Oligonychus ilicis*)、甘蔗小爪螨(*Oligonychus indicus*)、芒果小爪螨(*Oligonychus mangiferus*)、草地小爪螨(*Oligonychus pratensis*)、石榴小爪螨(*Oligonychus punicae*)、樟小爪螨(*Oligonychus yothersi*),钝缘蜱属(*Ornithodoros* spp.),禽刺螨属(*Ornithonyssus* spp.),全爪螨属(*Panonychus* spp.),例如桔全爪螨(*Panonychus citri*) (= *Metatetranychus citri*)、苹果全爪螨(*Panonychus ulmi*) (= *Metatetranychus ulmi*),桔芸锈螨(*Phyllocoptruta oleivora*),*Platytetranychus multidigituli*,侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonemus latus*),痒螨属(*Psoroptes* spp.),扇头蜱属(*Rhipicephalus* spp.),根螨属(*Rhizoglyphus* spp.),疥螨属(*Sarcoptes* spp.),中东金蝎(*Scorpio maurus*),狭跗线螨属(*Steneotarsonemus* spp.),稻细螨(*Steneotarsonemus spinki*),跗线螨属(*Tarsonemus* spp.),例如乱跗线螨(*Tarsonemus confusus*)、白跗线螨(*Tarsonemus pallidus*),叶螨属(*Tetranychus* spp.),例如*Tetranychus canadensis*、朱砂叶螨(*Tetranychus cinnabarinus*)、土耳其斯坦叶螨(*Tetranychus turkestanii*)、二斑叶螨(*Tetranychus urticae*),阿氏真恙螨(*Trombicula alfreddugesi*),*Vaejovis* spp.,番茄斜背瘤瘿螨(*Vasates lycopersici*);

[0588] 来自唇足纲(Chilopoda)的有害物,例如地蜈蚣属(*Geophilus* spp.)、蚰蜒属(*Scutigera* spp.);

[0589] 来自弹尾目或弹尾纲 (Collembola) 的有害物, 例如武装棘跳虫 (*Onychiurus armatus*); 绿圆跳虫 (*Sminthurus viridis*);

[0590] 来自倍足纲 (Diplopoda) 的有害物, 例如千足虫 (*Blaniulus guttulatus*);

[0591] 来自昆虫纲 (Insecta), 例如蜚蠊目 (Blattodea) 的有害物, 例如东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*), 亚洲蜚蠊 (*Blattella asahinai*)、德国蜚蠊 (*Blattella germanica*), 马德拉蜚蠊 (*Leucophaea maderae*), *Loboptera decipiens*, 家屋蟑螂 (*Neostylopyga rhombifolia*), 古巴蠊属 (*Panchlora* spp.), 木蠊属 (*Parcoblatta* spp.), 大蠊属 (*Periplaneta* spp.), 例如美洲大蠊 (*Periplaneta americana*)、澳洲大蠊 (*Periplaneta australasiae*), 苏里南潜蠊 (*Pycnoscelus surinamensis*), 棕带蜚蠊 (*Supella longipalpa*);

[0592] 来自鞘翅目 (Coleoptera) 的有害物, 例如 *Acalymma vittatum*, 菜豆象 (*Acanthoscelides obtectus*), 喙丽金龟属 (*Adoretus* spp.), 小蜂窝甲虫 (*Aethina tumida*), 杨毛臀萤叶甲 (*Agelastica alni*), 长吉丁属 (*Agrilus* spp.), 例如白蜡窄吉丁 (*Agrilus planipennis*)、*Agrilus coxalis*、栗双线窄吉丁 (*Agrilus bilineatus*)、桦铜窄吉丁 (*Agrilus anxius*), 叩甲属 (*Agriotes* spp.), 例如 *Agriotes linneatus*、小麦金针虫 (*Agriotes mancus*), 黑菌虫 (*Alphitobius diaperinus*), 马铃薯鳃角金龟 (*Amphimallon solstitialis*), 家具窃蠹 (*Anobium punctatum*), 星天牛属 (*Anoplophora* spp.), 例如光肩星天牛 (*Anoplophora glabripennis*), 花象属 (*Anthonomus* spp.), 例如棉铃象甲 (*Anthonomus grandis*), 圆皮蠹属 (*Anthrenus* spp.), 长喙小象属 (*Apion* spp.), 阿鳃金龟属 (*Apogonia* spp.), 隐食甲属 (*Atomaria* spp.), 例如甜菜隐食甲 (*Atomaria linearis*), 毛皮蠹属 (*Attagenus* spp.), *Baris caerulescens*, 恶条豆象 (*Bruchidius obtectus*), 豆象属 (*Bruchus* spp.), 例如豌豆象 (*Bruchus pisorum*)、蚕豆象 (*Bruchus rufimanus*), 龟金花虫属 (*Cassida* spp.), 菜豆莹叶甲 (*Cerotoma trifurcata*), *Ceutorrhynchus* spp., 例如 *Ceutorrhynchus assimilis*、*Ceutorrhynchus quadridens*、芜菁象甲 (*Ceutorrhynchus rapae*), 凹胫跳甲属 (*Chaetocnema* spp.), 例如 *Chaetocnema confinis*、*Chaetocnema denticulata*、*Chaetocnema ectypa*、*Cleonus mendicus*, 宽胸叩头虫属 (*Conoderus* spp.), 根颈象属 (*Cosmopolites* spp.), 例如香蕉象甲 (*Cosmopolites sordidus*), 褐新西兰肋翅鳃角金龟 (*Costelytra zealandica*), *Ctenicera* spp., 象虫属 (*Curculio* spp.), 例如核桃象甲 (*Curculio caryae*)、*Curculio caryatrypes*、*Curculio obtusus*、*Curculio sayi*, 锈赤扁谷盗 (*Cryptolestes ferrugineus*)、长角扁谷盗 (*Cryptolestes pusillus*), 杨干隐喙象 (*Cryptorhynchus lapathi*)、*Cryptorhynchus mangiferae*, 细枝象属 (*Cylindrocopturus* spp.), 密点细枝象 (*Cylindrocopturus adpersus*)、*Cylindrocopturus furnissi*, 大小蠹属 (*Dendroctonus* spp.), 例如中欧山松大小蠹 (*Dendroctonus ponderosae*), 皮蠹属 (*Dermestes* spp.), 叶甲属 (*Diabrotica* spp.), 例如黄瓜条叶甲 (*Diabrotica balteata*)、北方玉米根虫 (*Diabrotica barberi*)、十一星叶甲食根亚种 (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*、玉米根萤叶甲 (*Diabrotica virgifera virgifera*)、玉米根虫 (*Diabrotica virgifera zea*), 蛀野螟属 (*Dichocrocis* spp.), 水稻铁甲 (*Dicladispa armigera*), *Diloboderus* spp., *Epicaerus* spp., 食植瓢虫属 (*Epilachna* spp.), 例如南瓜

瓢虫 (*Epilachna borealis*)、墨西哥豆瓢虫 (*Epilachna varivestis*)、毛跳甲属 (*Epitrix* spp.)，例如黄瓜跳甲 (*Epitrix cucumeris*)、茄子叶甲 (*Epitrix fuscula*)、烟草跳甲 (*Epitrix hirtipennis*)、美国马铃薯跳甲 (*Epitrix subcrinita*)、块茎跳甲 (*Epitrix tuberis*)、*Faustinus* spp.、裸蛛甲 (*Gibbium psylloides*)、阔角谷盗 (*Gnathocerus cornutus*)、菜心螟 (*Hellula undalis*)、黑异爪蔗金龟 (*Heteronychus arator*)、寡节鳃金龟属 (*Heteronyx* spp.)、*Hylamorpha elegans*、北美家天牛 (*Hylotrupes bajulus*)、紫苜蓿叶象 (*Hypera postica*)、蓝绿象 (*Hypomeces squamosus*)、咪小蠹属 (*Hypothenemus* spp.)，例如咖啡果小蠹 (*Hypothenemus hampei*)、苹枝小囊 (*Hypothenemus obscurus*)、*Hypothenemus pubescens*、甘蔗大褐齿爪鳃金龟 (*Lachnosterna consanguinea*)、烟草甲 (*Lasioderma serricorne*)、长头谷盗 (*Latheticus oryzae*)、*Lathridius* spp.、合瓜负泥虫属 (*Lema* spp.)、科罗拉多马铃薯甲虫 (*Leptinotarsa decemlineata*)、银潜蛾属 (*Leucoptera* spp.)，例如咖啡潜叶蛾 (*Leucoptera coffeella*)、*Limonium ectypus*、稻根象 (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、卜象属 (*Listronotus* (= *Hyperodes*) spp.)、筒喙象属 (*Lixus* spp.)、*Luperodes* spp.、黄胸寡毛跳甲 (*Luperomorpha xanthodera*)、粉蠹属 (*Lyctus* spp.)、*Megacyllene* spp.，例如 *Megacyllene robiniae*、*Megascelis* spp.、梳爪叩头虫属 (*Melanotus* spp.)，例如 *Melanotus longulus oregonensis*、油菜露尾甲 (*Meligethes aeneus*)、鳃金龟属 (*Melolontha* spp.)，例如大栗鳃角金龟 (*Melolontha melolontha*)、*Migdolus* spp.、墨天牛属 (*Monochamus* spp.)、象甲 (*Naupactus xanthographus*)、隐跗郭公虫属 (*Necrobia* spp.)、*Neogalerucella* spp.、黄蛛甲 (*Niptus hololeucus*)、椰蛀犀金龟 (*Oryctes rhinoceros*)、锯谷盗 (*Oryzaephilus surinamensis*)、*Oryzaphagus oryzae*、耳象属 (*Otiorhynchus* spp.)，例如 *Otiorhynchus cribricollis*、大苜蓿耳象 (*Otiorhynchus ligustici*)、大苜蓿耳喙象 (*Otiorhynchus ovatus*)、*Otiorhynchus rugosostriatus*、黑葡萄耳象 (*Otiorhynchus sulcatus*)、负泥虫属 (*Oulema* spp.)，例如黑角负泥虫 (*Oulema melanopus*)、水稻负泥虫 (*Oulema oryzae*)、小青花金龟 (*Oxycetonia jucunda*)、辣根猿叶甲 (*Phaedon cochleariae*)、食叶鳃金龟属 (*Phyllophaga* spp.)、*Phyllophaga helleri*、菜跳甲属 (*Phyllotreta* spp.)，例如 *Phyllotreta armoraciae*、*Phyllotreta pusilla*、*Phyllotreta ramosa*、黄曲条跳甲 (*Phyllotreta striolata*)、日本弧丽金龟 (*Popillia japonica*)、安第斯马铃薯象属 (*Premnotrypes* spp.)、大谷蠹 (*Prostephanus truncatus*)、蚤跳甲属 (*Psylliodes* spp.)，例如 *Psylliodes affinis*、油菜金头跳甲 (*Psylliodes chrysocephala*)、*Psylliodes punctulata*、蛛甲属 (*Ptinus* spp.)、暗色瓢虫 (*Rhizobius ventralis*)、谷蠹 (*Rhizopertha dominica*)、隐颏象属 (*Rhynchophorus* spp.)、红棕象甲 (*Rhynchophorus ferrugineus*)、棕榈象甲 (*Rhynchophorus palmarum*)、小蠹属 (*Scolytus* spp.)，例如欧洲榆小蠹 (*Scolytus multistriatus*)、侧突双棘长蠹 (*Sinoxylon perforans*)、谷象属 (*Sitophilus* spp.)，例如麦子象鼻虫 (*Sitophilus granarius*)、*Sitophilus linearis*、米象 (*Sitophilus oryzae*)、玉米象 (*Sitophilus zeamais*)、尖隐喙象属 (*Sphenophorus* spp.)、药材甲 (*Stegobium paniceum*)、茎干象属 (*Sternechus* spp.)，例如豆茎象 (*Sternechus paludatus*)、*Symphyletes* spp.、纤毛象属 (*Tanymecus* spp.)，例如玉米象鼻虫 (*Tanymecus dilaticollis*)、*Tanymecus indicus*、*Tanymecus palliatus*、黄粉虫 (*Tenebrio molitor*)、

大谷盗 (*Tenebrioides mauretanicus*), 拟谷盗属 (*Tribolium* spp.), 例如 *Tribolium audax*、赤拟谷盗 (*Tribolium castaneum*)、杂拟谷盗 (*Tribolium confusum*), 斑皮蠹属 (*Trogoderma* spp.), 籽象属 (*Tychius* spp.), 脊虎天牛属 (*Xylotrechus* spp.), 距步甲属 (*Zabrus* spp.), 例如 *Zabrus tenebrioides*;

[0593] 来自革翅目 (Dermaptera) 的有害物, 例如海岸肥螋 (*Anisolabis maritime*)、欧洲球螋 (*Forficula auricularia*)、红螋 (*Labidura riparia*);

[0594] 来自双翅目 (Diptera) 的有害物, 例如伊蚊属 (*Aedes* spp.), 例如埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*)、白纹伊蚊 (*Aedes albopictus*)、叮刺伊蚊 (*Aedes sticticus*)、刺扰伊蚊 (*Aedes vexans*), 潜蝇属 (*Agromyza* spp.), 例如苜蓿斑潜蝇 (*Agromyza frontella*)、*Agromyza parvicornis*, 按实蝇属 (*Anastrepha* spp.), 按蚊属 (*Anopheles* spp.), 例如四斑按蚊 (*Anopheles quadrimaculatus*)、冈比亚按蚊 (*Anopheles gambiae*), 瘿蚊属 (*Asphondylia* spp.), 果实蝇属 (*Bactrocera* spp.), 例如瓜实蝇 (*Bactrocera cucurbitae*)、桔小实蝇 (*Bactrocera dorsalis*)、油橄榄果实蝇 (*Bactrocera oleae*), 花园毛蚊 (*Bibio hortulanus*), 红头丽蝇 (*Calliphora erythrocephala*)、红头丽蝇 (*Calliphora vicina*), 地中海实蝇 (*Ceratitis capitata*), 摇蚊属 (*Chironomus* spp.), 金蝇属 (*Chrysomya* spp.), 斑虻属 (*Chrysops* spp.), 高额麻虻 (*Chrysozona pluvialis*), *Cochliomya* spp., 康瘿蚊属 (*Contarinia* spp.), 例如葡萄瘿蚊 (*Contarinia johnsoni*)、甘蓝瘿蚊 (*Contarinia nasturtii*)、梨叶瘿蚊 (*Contarinia pyrivora*)、*Contarinia schulzi*、高粱瘿蚊 (*Contarinia sorghicola*)、麦黄吸浆虫 (*Contarinia tritici*), 人皮蝇 (*Cordylobia anthropophaga*), 环足摇蚊 (*Cricotopus sylvestris*), 库蚊属 (*Culex* spp.), 例如尖音库蚊 (*Culex pipiens*)、致倦库蚊 (*Culex quinquefasciatus*), 库蠓属 (*Culicoides* spp.), 脉毛蚊属 (*Culiseta* spp.), 黄蝇属 (*Cuterebra* spp.), 橄榄实蝇 (*Dacus oleae*), 叶瘿蚊属 (*Dasineura* spp.), 例如油菜莢叶瘿蚊 (*Dasineura brassicae*), 地种蝇属 (*Delia* spp.), 例如葱地种蝇 (*Delia antiqua*)、麦地种蝇 (*Delia coarctata*)、毛跗地种蝇 (*Delia florilega*)、灰地种蝇 (*Delia platura*)、甘蓝地种蝇 (*Delia radicum*), 人肤蝇 (*Dermatobia hominis*), 果蝇属 (*Drosophila* spp.), 例如黄猩猩果蝇 (*Drosophila melanogaster*)、樱桃果蝇 (*Drosophila suzukii*), 稻象属 (*Echinocnemus* spp.), *Euleia heraclei*, 厕蝇属 (*Fannia* spp.), 胃蝇属 (*Gasterophilus* spp.), 舌蝇属 (*Glossina* spp.), 麻虻属 (*Haematopota* spp.), 毛眼水蝇属 (*Hydrellia* spp.), 大麦水蝇 (*Hydrellia griseola*), 种蝇属 (*Hylemya* spp.), 虱蝇属 (*Hippobosca* spp.), 皮蝇属 (*Hypoderma* spp.), 斑潜蝇属 (*Liriomyza* spp.), 例如菜斑潜蝇 (*Liriomyza brassicae*)、南美斑潜蝇 (*Liriomyza huidobrensis*)、美洲斑潜蝇 (*Liriomyza sativae*), 绿蝇属 (*Lucilia* spp.), 例如铜绿蝇 (*Lucilia cuprina*), 罗蛉属 (*Lutzomyia* spp.), 曼蚊属 (*Mansonia* spp.), 家蝇属 (*Musca* spp.), 例如家蝇 (*Musca domestica*)、舍蝇 (*Musca domestica vicina*), 狂蝇属 (*Oestrus* spp.), 瑞典麦杆蝇 (*Oscinella frit*), *Paratanytarsus* spp., *Paralauterborniella subcincta*, 泉蝇属 (*Pegomya* 或 *Pegomyia* spp.), 例如甜菜蝇 (*Pegomya betae*)、甜菜潜叶蝇 (*Pegomya hyoscyami*)、悬钩子泉蝇 (*Pegomya rubivora*), 白蛉属 (*Phlebotomus* spp.), 草种蝇属 (*Phorbia* spp.), 伏蝇属 (*Phormia* spp.), 酪蝇 (*Piophilina casei*), 芦笋实蝇 (*Platyparea poeciloptera*), *Prodiplosis* spp., 胡萝卜茎

蝇 (*Psila rosae*), 绕实蝇属 (*Rhagoletis* spp.), 例如樱桃实蝇 (*Rhagoletis cingulata*)、核桃绕实蝇 (*Rhagoletis completa*)、黑樱桃实蝇 (*Rhagoletis fausta*)、欧洲甜樱桃绕实蝇 (*Rhagoletis indifferens*)、越橘绕实蝇 (*Rhagoletis mendax*)、苹果实蝇 (*Rhagoletis pomonella*), 麻蝇属 (*Sarcophaga* spp.), 蚋属 (*Simulium* spp.), 例如南方蚋 (*Simulium meridionale*), 螫蝇属 (*Stomoxys* spp.), 虻属 (*Tabanus* spp.), 根斑蝇属 (*Tetanops* spp.), 大蚊属 (*Tipula* spp.), 例如欧洲大蚊 (*Tipula paludosa*)、牧场大蚊 (*Tipula simplex*), 木瓜馱实蝇 (*Toxotrypana curvicauda*);

[0595] 来自半翅目 (Hemiptera) 的有害物, 例如 *Acizzia acaciaebaileyanae*、*Acizzia dodonaeae*、木虱 (*Acizzia uncatoides*), 头尖蝗 (*Acrida turrata*), 无网长管蚜属 (*Acyrtosiphon* spp.), 例如豌豆长管蚜 (*Acyrtosiphon pisum*), *Acrogonia* spp., *Aeneolamia* spp., 隆脉木虱属 (*Agonoscena* spp.), 粉虱属 (*Aleurocanthus* spp.), 欧洲甘蓝粉虱 (*Aleyrodes proletella*), 甘蔗穴粉虱 (*Aleurolobus barodensis*), 软毛粉虱 (*Aleurothrixus floccosus*), *Allocaridara malayensis*, 芒果叶蝉属 (*Amrasca* spp.), 例如 *Amrasca bigutulla*、叶蝉 (*Amrasca devastans*), 飞廉短尾蚜 (*Anuraphis cardui*), 肾圆盾介壳虫属 (*Aonidiella* spp.), 例如红肾圆盾蚜 (*Aonidiella aurantii*)、黄圆蹄盾蚜 (*Aonidiella citrina*)、赤圆介壳虫 (*Aonidiella inornata*), 梨瘤蚜 (*Aphanostigma piri*), 蚜属 (*Aphis* spp.), 例如苹果黄蚜 (*Aphis citricola*)、豆蚜 (*Aphis craccivora*)、甜菜蚜 (*Aphis fabae*)、草莓根蚜 (*Aphis forbesi*)、大豆蚜 (*Aphis glycines*)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)、*Aphis hederarum*、*Aphis illinoisensis*、*Aphis middletoni*、鼠李马铃薯蚜 (*Aphis nasturtii*)、夹竹桃蚜 (*Aphis nerii*)、苹果蚜 (*Aphis pomi*)、绣线菊蚜 (*Aphis spiraeicola*)、*Aphis viburniphila*, 葡萄叶蜂 (*Arboridia apicalis*), *Arytainilla* spp., 小圆盾蚜属 (*Aspidiella* spp.), 圆盾介壳虫属 (*Aspidiotus* spp.), 例如常春藤圆盾蚜 (*Aspidiotus nerii*), *Atanus* spp., 茄沟无网蚜 (*Aulacorthum solani*), 烟粉虱 (*Bemisia tabaci*), 澳大利亚木虱 (*Blastopsylla occidentalis*), *Boreioglycaspis melaleucaae*, 李短尾蚜 (*Brachycaudus helichrysi*), 微管蚜属 (*Brachycolus* spp.), 甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*), 喀木虱属 (*Cacopsylla* spp.), 例如梨木虱 (*Cacopsylla pyricola*), 小褐稻虱 (*Calligypona marginata*), *Capulinia* spp., 黄头大叶蝉 (*Carneocephala fulgida*), 甘蔗绵蚜 (*Ceratovacuna lanigera*), 沫蝉科 (*Cercopidae*), 蜡蚜属 (*Ceroplastes* spp.), 草莓钉蚜 (*Chaetosiphon fragaefolii*), 蔗黄雪盾介 (*Chionaspis tegalensis*), 茶绿叶蜂 (*Chlorita onukii*), 中国台湾大蝗 (*Chondracris rosea*), 核桃黑斑蚜 (*Chromaphis juglandicola*), 褐圆蚜 (*Chrysomphalus aonidum*)、黑褐圆盾蚜 (*Chrysomphalus ficus*), 玉米叶蝉 (*Cicadulina mbila*), *Coccomytilus halli*, 软蚜属 (*Coccus* spp.), 例如褐软蜡蚜 (*Coccus hesperidum*)、长椭圆软蚜 (*Coccus longulus*)、橘软蜡蚜 (*Coccus pseudomagnoliarum*)、咖啡绿软蚜 (*Coccus viridis*), 隐瘤蚜 (*Cryptomyzus ribis*), *Cryptoneossa* spp., *Ctenarytaina* spp., *Dalbulus* spp., *Dialeurodes chittendeni*, 柑橘粉虱 (*Dialeurodes citri*), 柑橘木虱 (*Diaphorina citri*), 白背盾蚜属 (*Diaspis* spp.), 双尾蚜属 (*Diuraphis* spp.), *Doralis* spp., 草履介壳虫属 (*Drosicha* spp.), 西圆尾蚜属 (*Dysaphis* spp.), 例如 *Dysaphis apiifolia*、车前圆尾蚜 (*Dysaphis plantaginea*)、百合西圆尾蚜 (*Dysaphis tulipae*), 灰粉蚜属 (*Dysmicoccus* spp.), 小绿叶

蝉属 (*Empoasca* spp.), 例如西部马铃薯叶蝉 (*Empoasca abrupta*)、马铃薯小绿叶蝉 (*Empoasca fabae*)、苹果小绿叶蝉 (*Empoasca maligna*)、*Empoasca solana*、*Empoasca stevensi*, 绵蚜属 (*Eriosoma* spp.), 例如 *Eriosoma americanum*、苹果绵蚜 (*Eriosoma lanigerum*)、*Eriosoma pyricola*, 斑叶蝉属 (*Erythroneura* spp.), *Eucalyptolyma* spp., 褐木虱属 (*Euphyllura* spp.), *Euscelis bilobatus*, 弗氏粉蚧属 (*Ferrisia* spp.), 围盾介壳虫属 (*Fiorinia* spp.), *Furcaspis oceanica*, 咖啡地粉蚧 (*Geococcus coffeae*), *Glycaspis* spp., 银合欢木虱 (*Heteropsylla cubana*), *Heteropsylla spinulosa*, 琉璃叶蝉 (*Homalodisca coagulata*), 桃大尾蚜 (*Hyalopterus arundinis*), 桃粉蚜 (*Hyalopterus pruni*), 吹绵蚧属 (*Icerya* spp.), 例如吹绵蚧 (*Icerya purchasi*), 片角叶蝉属 (*Idiocerus* spp.), 扁喙叶蝉属 (*Idioscopus* spp.), 灰飞虱 (*Laodelphax striatellus*), 蜡蚧属 (*Lecanium* spp.), 例如 *Lecanium corni* (= 扁平球坚蚧 (*Parthenolecanium corni*)), 牡蛎蚧属 (*Lepidosaphes* spp.), 例如榆蛎盾蚧 (*Lepidosaphes ulmi*), 萝卜蚜 (*Lipaphis erysimi*), 日本长白盾蚧 (*Lopholeucaspis japonica*), 斑衣蜡蝉 (*Lycorma delicatula*), 长管蚜属 (*Macrosiphum* spp.), 例如马铃薯长管蚜 (*Macrosiphum euphorbiae*)、*Macrosiphum lilii*、蔷薇长管蚜 (*Macrosiphum rosae*), 紫菀点叶蝉 (*Macrosteles facifrons*), *Mahanarva* spp., 高粱蚜 (*Melanaphis sacchari*), *Metcalfiella* spp., *Metcalfa pruinosa*, 麦无网长管蚜 (*Metopolophium dirhodum*), 黑缘平翅斑蚜 (*Monellia costalis*), *Monelliopsis pecanis*, 瘤蚜属 (*Myzus* spp.), 例如冬葱瘤额蚜 (*Myzus ascalonicus*)、李瘤蚜 (*Myzus cerasi*)、*Myzus ligustri*、莴菜瘤蚜 (*Myzus ornatus*)、桃蚜 (*Myzus persicae*)、烟蚜 (*Myzus nicotianae*), 莴苣蚜 (*Nasonovia ribisnigri*), 新马粉虱属 (*Neomaskellia* spp.), 黑尾叶蝉属 (*Nephotettix* spp.), 例如黑尾叶蝉 (*Nephotettix cincticeps*)、二条斑黑尾叶蝉 (*Nephotettix nigropictus*), *Nettignocella spectra*, 褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*), *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, 中华稻蝗 (*Oxya chinensis*), *Pachypsylla* spp., 杨梅粉虱 (*Parabemisia myricae*), *Paratrioza* spp., 例如 *Paratrioza cockerelli*, 片盾蚧属 (*Parlatoria* spp.), 瘿绵蚜属 (*Pemphigus* spp.), 例如囊柄瘿绵蚜 (*Pemphigus bursarius*)、*Pemphigus populivenae*, 玉米蜡蝉 (*Peregrinus maidis*), 扁角飞虱属 (*Perkinsiella* spp.), 绵粉蚧属 (*Phenacoccus* spp.), 例如苏铁褐点并盾蚧 (*Phenacoccus madeirensis*), 杨平翅绵蚜 (*Phloeomyzus passerinii*), 忽布疣蚜 (*Phorodon humuli*), 葡萄根瘤蚜属 (*Phylloxera* spp.), 例如 *Phylloxera devastatrix*、警根瘤蚜 (*Phylloxera notabilis*), 苏铁褐点并盾蚧 (*Pinnaspis aspidistrae*), 臀纹粉蚧属 (*Planococcus* spp.), 例如桔粉介壳虫 (*Planococcus citri*), *Prosopidopsylla flava*, 梨形原绵腊蚧 (*Protopulvinaria pyriformis*), 桑白蚧 (*Pseudaulacaspis pentagona*), 粉蚧属 (*Pseudococcus* spp.), 例如嗜桔粉蚧 (*Pseudococcus calceolariae*)、康氏粉蚧 (*Pseudococcus comstocki*)、长尾粉蚧 (*Pseudococcus longispinus*)、葡萄粉蚧 (*Pseudococcus maritimus*)、暗色粉蚧 (*Pseudococcus viburni*), *Psyllopsis* spp., 木虱属 (*Psylla* spp.), 例如 *Psylla buxi*、苹木虱 (*Psylla mali*)、梨木虱 (*Psylla pyri*), 金小蜂属 (*Pteromalus* spp.), 绵蚧属 (*Pulvinaria* spp.), *Pyrilla* spp., 笠圆盾蚧属 (*Quadraspidotus* spp.), 例如胡桃圆盾蚧 (*Quadraspidotus juglansregiae*)、杨笠圆盾蚧 (*Quadraspidotus ostreaeformis*)、梨圆盾蚧 (*Quadraspidotus perniciosus*),

Quesada gigas, 平刺粉蚧属 (*Rastrococcus* spp.), 缢管蚜属 (*Rhopalosiphum* spp.), 例如玉米蚜 (*Rhopalosiphum maidis*)、*Rhopalosiphum oxyacanthae*、禾谷缢管蚜 (*Rhopalosiphum padi*)、红腹缢管蚜 (*Rhopalosiphum rufiabdominale*)、黑盔蚧属 (*Saissetia* spp.), 例如咖啡黑盔蚧 (*Saissetia coffeae*)、*Saissetia miranda*、*Saissetia neglecta*、橄榄黑盔蚧 (*Saissetia oleae*)、葡萄带叶蝉 (*Scaphoideus titanus*)、麦二叉蚜 (*Schizaphis graminum*)、刺盾蚧 (*Selenaspidus articulatus*)、*Sipha flava*、麦长管蚜 (*Sitobion avenae*)、长唇基飞虱属 (*Sogata* spp.), 白背飞虱 (*Sogatella furcifera*)、*Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*、树粉虱 (*Siphoninus phillyreae*)、*Tenalaphara malayensis*、*Tetragonocephala* spp., 美洲山核桃长斑蚜 (*Tinocallis caryaefoliae*)、广胸沫蝉属 (*Tomaspis* spp.), 桔蚜属 (*Toxoptera* spp.), 例如桔二叉蚜 (*Toxoptera aurantii*)、桔蚜 (*Toxoptera citricidus*)、温室粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*)、尖翅木虱属 (*Trioza* spp.), 例如 *Trioza diospyri*、小叶蝉属 (*Typhlocyba* spp.), 矢盾介壳虫属 (*Unaspis* spp.), 葡萄根瘤蚜 (*Viteus vitifolii*)、么叶蝉属 (*Zygina* spp.);

[0596] 来自异翅亚目 (*Heteroptera*) 的有害物, 例如麦蝽属 (*Aelia* spp.), 南瓜缘蝽 (*Anasa tristis*)、拟丽蝽属 (*Antestiopsis* spp.)、*Boisea* spp., 土长蝽属 (*Blissus* spp.)、俊盲蝽属 (*Calocoris* spp.)、*Campylomma livida*、异背长蝽属 (*Cavelerius* spp.)、臭虫属 (*Cimex* spp.), 例如 *Cimex adjunctus*、热带臭虫 (*Cimex hemipterus*)、温带臭虫 (*Cimex lectularius*)、蝠臭虫 (*Cimex pilosellus*)、*Collaria* spp., 绿盲蝽 (*Creontiades dilutus*)、胡椒缘蝽 (*Dasynus piperis*)、*Dichelops furcatus*、厚氏长棒网蝽 (*Diconocoris hewetti*)、棉红蝽属 (*Dysdercus* spp.)、美洲蝽属 (*Euschistus* spp.), 例如褐蝽 (*Euschistus heros*)、褐臭蝽 (*Euschistus servus*)、三点美洲蝽 (*Euschistus tristigma*)、*Euschistus variolarius*、菜蝽属 (*Eurydema* spp.)、扁盾蝽属 (*Eurygaster* spp.)、茶翅蝽 (*Halyomorpha halys*)、*Heliopeltis* spp., *Horcias nobilellus*、稻缘蝽属 (*Leptocorisa* spp.)、异稻缘蝽 (*Leptocorisa varicornis*)、*Leptoglossus occidentalis*、叶喙缘蝽 (*Leptoglossus phyllopus*)、丽盲蝽属 (*Lygocoris* spp.), 例如原丽盲蝽 (*Lygocoris pabulinus*)、草盲蝽属 (*Lygus* spp.), 例如 *Lygus elisus*、豆荚盲蝽 (*Lygus hesperus*)、美洲牧草盲蝽 (*Lygus lineolaris*)、蔗黑长蝽 (*Macropes excavatus*)、筛豆龟蝽 (*Megacopta cribraria*)、盲蝽科 (*Miridae*)、*Monalonion atratum*、绿蝽属 (*Nezara* spp.), 例如稻绿蝽 (*Nezara viridula*)、小长蝽属 (*Nysius* spp.)、*Oebalus* spp., *Pentomidae*、方背皮蝽 (*Piesma quadrata*)、壁蝽属 (*Piezodorus* spp.), 例如 *Piezodorus guildinii*、杂盲蝽属 (*Psallus* spp.)、*Pseudacysta perseae*、红猎蝽属 (*Rhodnius* spp.)、可可褐盲蝽 (*Sahlbergella singularis*)、*Scaptocoris castanea*、黑蝽属 (*Scotinophora* spp.)、梨冠网蝽 (*Stephanitis nashi*)、*Tibraca* spp., 锥猎蝽属 (*Triatoma* spp.);

[0597] 来自膜翅目 (*Hymenoptera*) 的有害物, 例如顶切叶蚁属 (*Acromyrmex* spp.)、菜叶蜂属 (*Athalia* spp.), 例如黄翅菜叶蜂 (*Athalia rosae*)、切叶蚁属 (*Atta* spp.)、弓背蚁属 (*Camponotus* spp.)、长黄胡蜂属 (*Dolichovespula* spp.)、松叶蜂属 (*Diprion* spp.), 例如类欧松叶蜂 (*Diprion similis*)、实叶蜂属 (*Hoplocampa* spp.), 例如樱实叶蜂 (*Hoplocampa cookei*)、*Hoplocampa testudinea*、毛蚁属 (*Lasius* spp.)、阿根廷蚁 (*Linepithema*

(*Iridomyrmex*) *humile*), 小家蚁 (*Monomorium pharaonis*), 立毛蚁属 (*Paratrechina* spp.), *Paravespula* spp., 斜结蚁属 (*Plagiolepis* spp.), 树蜂属 (*Sirex* spp.), 例如云杉树蜂 (*Sirex noctilio*), 红火蚁 (*Solenopsis invicta*), *Tapinoma* spp., 白足狡臭蚁 (*Technomyrmex albipes*), 树蜂属 (*Urocerus* spp.), 胡蜂属 (*Vespa* spp.), 例如黄边胡蜂 (*Vespa crabro*), 小火蚁 (*Wasmannia auropunctata*), 黑树蜂属 (*Xeris* spp.);

[0598] 来自等足目 (*Isopoda*) 的有害物, 例如鼠妇 (*Armadillidium vulgare*)、栉水虱 (*Oniscus asellus*)、球鼠妇 (*Porcellio scaber*);

[0599] 来自等翅目 (*Isoptera*) 的有害物, 例如乳白蚁属 (*Coptotermes* spp.), 例如中国台湾乳白蚁 (*Coptotermes formosanus*), 堆角白蚁 (*Cornitermes cumulans*), 堆砂白蚁属 (*Cryptotermes* spp.), 楹白蚁属 (*Incisitermes* spp.), 木白蚁属 (*Kaloterms* spp.), 稻麦小白蚁 (*Microtermes obesi*), 象白蚁属 (*Nasutitermes* spp.), 土白蚁属 (*Odontotermes* spp.), 洞白蚁属 (*Porotermes* spp.), 散白蚁属 (*Reticulitermes* spp.), 例如北美散白蚁 (*Reticulitermes flavipes*)、西方散白蚁 (*Reticulitermes hesperus*);

[0600] 来自鳞翅目 (*Lepidoptera*) 的有害物, 例如小蜡螟 (*Achroia grisella*), 桑剑纹夜蛾 (*Acronicta major*), 褐带卷蛾属 (*Adoxophyes* spp.), 例如棉褐带卷蛾 (*Adoxophyes orana*), 烦夜蛾 (*Aedia leucomelas*), 地老虎属 (*Agrotis* spp.), 例如黄地老虎 (*Agrotis segetum*)、小地老虎 (*Agrotis ipsilon*), 波纹夜蛾属 (*Alabama* spp.), 例如棉叶波纹夜蛾 (*Alabama argillacea*), 脐橙螟 (*Amyelois transitella*), 条麦蛾属 (*Anarsia* spp.), 干煞夜蛾属 (*Anticarsia* spp.), 例如大豆夜蛾 (*Anticarsia gemmatalis*), 条小卷蛾属 (*Argyroproce* spp.), 丫纹夜蛾属 (*Autographa* spp.), 甘蓝夜蛾 (*Barathra brassicae*), 苹髓尖蛾 (*Blastodacna atra*), 禾弄蝶 (*Borbo cinnara*), 棉潜蛾 (*Bucculatrix thurberiella*), 松尺蠖 (*Bupalus piniarius*), 蛀褐夜蛾属 (*Busseola* spp.), *Cacoecia* spp., 茶细蛾 (*Caloptilia theivora*), 烟卷蛾 (*Capua reticulana*), 苹果蠹蛾 (*Carpocapsa pomonella*), 桃蛀果蛾 (*Carposina niponensis*), 冬尺蛾 (*Cheimatobia brumata*), 禾草螟属 (*Chilo* spp.), 例如 *Chilo plejadellus*、二化螟 (*Chilo suppressalis*), 苹果舞蛾 (*Choreutis pariana*), 色卷蛾属 (*Choristoneura* spp.), 裸纹夜蛾 (*Chrysodeixis chalcites*), 葡萄果蠹蛾 (*Clysia ambiguella*), 卷螟属 (*Cnaphalocerus* spp.), 稻纵卷叶螟 (*Cnaphalocrocis medinalis*), 云卷蛾属 (*Cnephasia* spp.), *Conopomorpha* spp., 球颈象属 (*Conotrachelus* spp.), *Copitarsia* spp., 小卷蛾属 (*Cydia* spp.), 例如豌豆小卷蛾 (*Cydia nigricana*)、苹果蠹蛾 (*Cydia pomonella*), *Dalaca noctuides*, 绢野螟属 (*Diaphania* spp.), *Diparopsis* spp., 小蔗螟 (*Diatraea saccharalis*), 松梢螟属 (*Dioryctria* spp.), 例如美洲松梢斑螟 (*Dioryctria zimmermani*), 钻夜蛾属 (*Earias* spp.), *Ecdytolopha aurantium*, 南美玉米苗斑螟 (*Elasmopalpus lignosellus*), 非洲蔗螟 (*Eldana saccharina*), 粉斑螟属 (*Ephestia* spp.), 例如烟草粉斑螟 (*Ephestia elutella*)、地中海粉螟 (*Ephestia kuehniella*), 叶小卷蛾属 (*Epinotia* spp.), 苹淡褐卷蛾 (*Epiphyas postvittana*), 松尺蛾属 (*Erannis* spp.), *Erschoviella musculana*, 莢斑螟属 (*Etiella* spp.), 艳叶夜蛾属 (*Eudocima* spp.), 棕卷蛾属 (*Eulia* spp.), 女贞细卷蛾 (*Eupoecilia ambiguella*), 黄毒蛾属 (*Euproctis* spp.), 例如黄毒蛾 (*Euproctis chrysorrhoea*), 切夜蛾属 (*Euxoa* spp.), 脏切叶蛾属 (*Feltia* spp.), 大蜡螟 (*Galleria*

mellonella), 细蛾属 (*Gracillaria* spp.), 小食心虫属 (*Grapholita* spp.), 例如梨小食心虫 (*Grapholita molesta*)、杏小食心虫 (*Grapholita prunivora*), 蚀叶野螟属 (*Hedylepta* spp.), 铃夜蛾属 (*Helicoverpa* spp.), 例如棉铃虫 (*Helicoverpa armigera*)、美洲棉铃虫 (*Helicoverpa zea*), 实夜蛾属 (*Heliothis* spp.), 例如烟芽夜蛾 (*Heliothis virescens*), 褐织蛾 (*Hofmannophila pseudospretella*), 同斑螟属 (*Homoeosoma* spp.), 长卷蛾属 (*Homona* spp.), 苹果巢蛾 (*Hyponomeuta padella*), 柿蒂虫 (*Kakivoria flavofasciata*), 亮灰蝶属 (*Lampides* spp.), 贪夜蛾属 (*Laphygma* spp.), *Laspeyresia molesta*, 茄黄斑螟 (*Leucinodes orbonalis*), 潜叶蛾属 (*Leucoptera* spp.), 例如咖啡潜叶蛾 (*Leucoptera coffeella*), 潜叶细蛾属 (*Lithocolletis* spp.), 例如苹细蛾 (*Lithocolletis blancardella*), 绿果冬夜蛾 (*Lithophane antennata*), 花翅小卷蛾属 (*Lobesia* spp.), 例如葡萄花翅小卷蛾 (*Lobesia botrana*), 豆白隆切根虫 (*Loxagrotis albicosta*), 毒蛾属 (*Lymantria* spp.), 例如舞毒蛾 (*Lymantria dispar*), 潜蛾属 (*Lyonetia* spp.), 例如桃潜蛾 (*Lyonetia clerkella*), 黄褐天幕毛虫 (*Malacosoma neustria*), 豆野螟 (*Maruca testulalis*), 甘蓝夜蛾 (*Mamestra brassicae*), 暮眼蝶 (*Melanitis leda*), 毛胫夜蛾属 (*Mocis* spp.), *Monopis obviella*, 粘虫 (*Mythimna separata*), *Nemapogon cloacellus*, 水螟属 (*Nymphula* spp.), *Oiketicus* spp., *Omphisa* spp., 秋尺蛾属 (*Operophtera* spp.), *Oria* spp., 瘤丛螟属 (*Orthaga* spp.), 秆野螟属 (*Ostrinia* spp.), 例如欧洲玉米螟 (*Ostrinia nubilalis*), 小眼夜蛾 (*Panolis flammea*), 稻弄蝶属 (*Parnara* spp.), 红铃麦蛾属 (*Pectinophora* spp.), 例如棉红铃虫 (*Pectinophora gossypiella*), *Perileucoptera* spp., 块茎蛾属 (*Phthorimaea* spp.), 例如马铃薯块茎蛾 (*Phthorimaea operculella*), 柑桔潜叶蛾 (*Phyllocnistis citrella*), 小潜细蛾属 (*Phyllonorycter* spp.), 例如斑幕潜叶蛾 (*Phyllonorycter blancardella*)、*Phyllonorycter crataegella*, 菜粉蝶属 (*Pieris* spp.), 例如菜粉蝶 (*Pieris rapae*), 荷兰石竹小卷蛾 (*Platynota stultana*), 印度谷螟 (*Plodia interpunctella*), 金翅夜蛾属 (*Plusia* spp.), 小菜蛾 (*Plutella xylostella*) (=小菜蛾 (*Plutella maculipennis*)), *Podesia* spp., 例如 *Podesia syringae*, 小白巢蛾属 (*Prays* spp.), 斜纹夜蛾属 (*Prodenia* spp.), 烟草天蛾属 (*Protoparce* spp.), 黏虫属 (*Pseudaletia* spp.), 例如一星黏虫 (*Pseudaletia unipuncta*), 大豆尺夜蛾 (*Pseudoplusia includens*), 玉米螟 (*Pyrausta nubilalis*), 薄荷灰夜蛾 (*Rachiplusia nu*), 禾螟属 (*Schoenobius* spp.), 例如 *Schoenobius bipunctifer*, 白禾螟属 (*Scirpophaga* spp.), 例如稻白螟 (*Scirpophaga innotata*), 黄地老虎 (*Scotia segetum*), 蛀茎夜蛾属 (*Sesamia* spp.), 例如大螟 (*Sesamia inferens*), 长须卷蛾属 (*Sparganothis* spp.), 灰翅夜蛾属 (*Spodoptera* spp.), 例如 *Spodoptera eradiana*, 甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua*), 草地贪夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*), *Spodoptera praefica*, 展足蛾属 (*Stathmopoda* spp.), *Stenoma* spp., 花生卷叶麦蛾 (*Stomopteryx subsecivella*), 透翅蛾属 (*Synanthedon* spp.), 安第斯马铃薯块茎蛾 (*Tecia solanivora*), 异舟蛾属 (*Thaumetopoea* spp.), *Thermesia gemmatalis*, 木塞谷蛾 (*Tinea cloacella*), 袋谷蛾 (*Tinea pellionella*), 幕谷蛾 (*Tineola bisselliella*), 卷蛾属 (*Tortrix* spp.), 毛毡衣蛾 (*Trichophaga tapetzella*), 粉夜蛾属 (*Trichoplusia* spp.), 例如粉纹夜蛾 (*Trichoplusia ni*), 三化螟 (*Tryporyza incertulas*), 番茄斑潜蝇

(*Tuta absoluta*), 灰蝶属 (*Virachola* spp.);

[0601] 来自直翅目 (Orthoptera) 或跳跃目 (Saltatoria) 的有害物, 例如家蟋蟀 (*Acheta domesticus*), *Dichroplus* spp., 蝼蛄属 (*Gryllotalpa* spp.), 例如欧洲蝼蛄 (*Gryllotalpa gryllotalpa*), 蔗蝗属 (*Hieroglyphus* spp.), 飞蝗属 (*Locusta* spp.), 例如东亚飞蝗 (*Locusta migratoria*), 黑蝗属 (*Melanoplus* spp.), 例如 *Melanoplus devastator*, *Paratlanticus ussuriensis*, 沙漠蝗 (*Schistocerca gregaria*);

[0602] 来自虱目 (Phthiraptera) 的有害物, 例如畜虱属 (*Damalinea* spp.), 血虱属 (*Haematopinus* spp.), 毛虱属 (*Linognathus* spp.), 虱属 (*Pediculus* spp.), 葡萄根瘤蚜 (*Phylloxera vastatrix*), 阴虱 (*Phthirus pubis*), 嚼虱属 (*Trichodectes* spp.);

[0603] 来自啮虫目 (Psocoptera) 的有害物, 例如 *Lepinotus* spp., 书虱属 (*Liposcelis* spp.);

[0604] 来自蚤目 (Siphonaptera) 的有害物, 例如角叶蚤属 (*Ceratophyllus* spp.), 栉首蚤属 (*Ctenocephalides* spp.), 例如犬栉首蚤 (*Ctenocephalides canis*)、猫栉首蚤 (*Ctenocephalides felis*), 致痒蚤 (*Pulex irritans*), 穿皮潜蚤 (*Tunga penetrans*), 印鼠客蚤 (*Xenopsylla cheopis*);

[0605] 来自缨翅目 (Thysanoptera) 的有害物, 例如玉米黄呆蓟马 (*Anaphothrips obscurus*), 稻蓟马 (*Baliothrips biformis*), *Chaetanaphothrips leeuweni*, 鲜食葡萄镰蓟马 (*Drepanothrips reuteri*), *Enneothrips flavens*, 花蓟马属 (*Frankliniella* spp.), 例如烟褐花蓟马 (*Frankliniella fusca*)、西花蓟马 (*Frankliniella occidentalis*)、苏花蓟马 (*Frankliniella schultzei*)、东方花蓟马 (*Frankliniella tritici*)、*Frankliniella vaccinii*、威廉期花蓟马 (*Frankliniella williamsi*), 简管蓟马属 (*Haplothrips* spp.), 阳蓟马属 (*Heliothrips* spp.), 温室条蓟马 (*Hercinothrips femoralis*), 卡蓟马属 (*Kakothrips* spp.), 葡萄蓟马 (*Rhipiphorothrips cruentatus*), 硬蓟马属 (*Scirtothrips* spp.), *Taeniothrips cardamomi*, 蓟马属 (*Thrips* spp.), 例如棕榈蓟马 (*Thrips palmi*)、葱蓟马 (*Thrips tabaci*);

[0606] 来自衣鱼目 (*Zygentoma*) (= 缨尾目 (*Thysanura*)) 的有害物, 例如栉衣鱼属 (*Ctenolepisma* spp.), 衣鱼 (*Lepisma saccharina*), 盗火虫 (*Lepismodes inquilinus*), 小灶衣鱼 (*Thermobia domestica*);

[0607] 来自综合纲 (Symphyla) 的有害物, 例如么蚰属 (*Scutigera* spp.), 例如白松虫 (*Scutigera immaculata*);

[0608] 来自软体动物门 (Mollusca)、例如双壳纲 (Bivalvia) 的有害物, 例如饰贝属 (*Dreissena* spp.);

[0609] 以及来自腹足纲 (Gastropoda) 的有害物, 例如阿勇蛞蝓属 (*Arion* spp.), 例如黑蛞蝓 (*Arion ater rufus*), 双脐螺属 (*Biomphalaria* spp.), 泡螺属 (*Bulinus* spp.), 野蛞蝓属 (*Deroceras* spp.), 例如光滑野蛞蝓 (*Deroceras laeve*), 土蜗属 (*Galba* spp.), 椎实螺属 (*Lymnaea* spp.), 钉螺属 (*Oncomelania* spp.), 福寿螺属 (*Pomacea* spp.), 琥珀螺属 (*Succinea* spp.);

[0610] 来自线虫动物门 (Nematoda) 的植物有害物, 即植物寄生性线虫, 特别是野外垫刃属 (*Aglenchus* spp.), 例如居农野外垫刃线虫 (*Aglenchus agricola*), 粒线虫属 (*Anguina*

spp.), 例如小麦粒线虫 (*Anguina tritici*), 滑刃线虫属 (*Aphelenchoides* spp.), 例如花生滑刃线虫 (*Aphelenchoides arachidis*)、草莓滑刃线虫 (*Aphelenchoides fragariae*), 刺线虫属 (*Belonolaimus* spp.), 例如细小刺线虫 (*Belonolaimus gracilis*)、长尾刺线虫 (*Belonolaimus longicaudatus*)、*Belonolaimus nortoni*, 伞滑刃线虫属 (*Bursaphelenchus* spp.), 例如椰子红环腐线虫 (*Bursaphelenchus cocophilus*)、*Bursaphelenchus eremus*、松材线虫 (*Bursaphelenchus xylophilus*)、*Cacopaurus* spp., 例如 *Cacopaurus pestis*, 小环线虫属 (*Criconemella* spp.), 例如弯曲小环线虫 (*Criconemella curvata*)、刻线小环线虫 (*Criconemella onoensis*)、装饰小环线虫 (*Criconemella ornata*)、*Criconemella rusium*、薄叶小环线虫 (*Criconemella xenoplax*) (=异盘中环线虫 (*Mesocriconema xenoplax*)), 轮线虫属 (*Criconemoides* spp.), 例如 *Criconemoides ferniae*、*Criconemoides onoense*、*Criconemoides ornatum*, 茎线虫属 (*Ditylenchus* spp.), 例如鳞球茎茎线虫 (*Ditylenchus dipsaci*), 锥线虫属 (*Dolichodorus* spp.), 球异皮线虫属 (*Globodera* spp.), 例如马铃薯白线虫 (*Globodera pallida*)、马铃薯金线虫 (*Globodera rostochiensis*), 螺旋线虫属 (*Helicotylenchus* spp.), 例如双宫螺旋线虫 (*Helicotylenchus dihystra*), 半轮线虫属 (*Hemicriconemoides* spp.), 鞘线虫属 (*Hemicycliophora* spp.), 异皮线虫属 (*Heterodera* spp.), 例如燕麦胞囊线虫 (*Heterodera avenae*)、大豆胞囊线虫 (*Heterodera glycines*)、甜菜胞囊线虫 (*Heterodera schachtii*), 潜根线虫属 (*Hirschmaniella* spp.), 纽带线虫属 (*Hoplolaimus* spp.), 长针线虫属 (*Longidorus* spp.), 例如非洲长针线虫 (*Longidorus africanus*), 根结线虫属 (*Meloidogyne* spp.), 例如哥伦比亚根结线虫 (*Meloidogyne chitwoodi*)、伪根结线虫 (*Meloidogyne fallax*)、北方根结线虫 (*Meloidogyne hapla*)、南方根结线虫 (*Meloidogyne incognita*), 瓢线虫属 (*Meloinema* spp.), 珍珠线虫属 (*Nacobbus* spp.), 拟茎线虫属 (*Neotylenchus* spp.), 拟长针线虫属 (*Paralongidorus* spp.), 拟滑刃线虫属 (*Paraphelenchus* spp.), 拟毛刺线虫属 (*Paratrichodorus* spp.), 例如较小拟毛刺线虫 (*Paratrichodorus minor*), 针线虫属 (*Paratylenchus* spp.), 短体线虫属 (*Pratylenchus* spp.), 例如穿刺短体线虫 (*Pratylenchus penetrans*), *Pseudohalenchus* spp., 平滑垫刃属 (*Psilenchus* spp.), 斑皮胞囊线虫属 (*Punctodera* spp.), 五沟线虫属 (*Quinisulcius* spp.), 穿孔线虫属 (*Radopholus* spp.), 例如柑橘穿孔线虫 (*Radopholus citrophilus*)、香蕉穿孔线虫 (*Radopholus similis*), 肾状线虫属 (*Rotylenchulus* spp.), 盘旋线虫属 (*Rotylenchus* spp.), 盾线虫属 (*Scutellonema* spp.), 亚蛇形线虫属 (*Subanguina* spp.), 毛刺线虫属 (*Trichodorus* spp.), 例如 *Trichodorus obtusus*、原始毛刺线虫 (*Trichodorus primitivus*), 矮化线虫属 (*Tylenchorhynchus* spp.), 例如饰环矮化线虫 (*Tylenchorhynchus annulatus*), 半穿刺线虫属 (*Tylenchulus* spp.), 例如柑橘半穿刺线虫 (*Tylenchulus semipenetrans*), 剑线虫属 (*Xiphinema* spp.), 例如标准剑线虫 (*Xiphinema index*)。

[0611] 在特定浓度或施用率下, 式 (I) 的化合物还可根据情况用作除草剂、安全剂、生长调节剂或用以改善植物性能的试剂, 用作杀微生物剂或杀配子剂, 例如用作杀真菌剂、抗霉菌剂、杀细菌剂、杀病毒剂 (包括抗类病毒的试剂) 或用作抗MLO (类支原体生物) 和RLO (类立克次氏体生物) 的试剂。根据情况, 它们还可用作其他活性化合物合成的中间体或前体。

[0612] 制剂

[0613] 本发明还涉及作为农药的包含至少一种式(I)的化合物的制剂和由其制备的施用形式,例如浸液、滴液和喷液。任选地,所述施用形式包含其他农药和/或改善作用的佐剂,例如渗透剂,例如植物油(例如菜籽油、葵花油)、矿物油(例如石蜡油)、植物脂肪酸的烷基酯(例如菜籽油甲酯或豆油甲酯)或烷醇烷氧基化物;和/或铺展剂(spreader),例如烷基硅氧烷和/或盐,例如有机或无机铵盐或磷盐,例如硫酸铵或磷酸氢二铵;和/或保持促进剂,例如磺基琥珀酸二辛酯或羟丙基瓜儿胶聚合物;和/或保湿剂,例如甘油;和/或肥料,例如含铵、含钾或含磷的肥料。

[0614] 常规制剂例如水溶性液剂(SL)、乳液浓缩剂(EC)、水乳剂(EW)、悬浮浓缩剂(SC、SE、FS、OD)、水分散性颗粒剂(WG)、颗粒剂(GR)和胶囊浓缩剂(CS);这些制剂和其他可能的制剂类型例如由国际作物生命组织(Crop Life International)记载于以下文献中:农药说明书(Pesticide Specifications)、联合国粮农组织和世界卫生组织农药说明书开发与使用手册(Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides)、联合国粮农组织植物生产与保护文献-173(FAO Plant Production and Protection Papers-173)(由联合国粮农组织/世界卫生组织关于农药说明书的联合会议制订,2004,ISBN:9251048576)。除一种或多种式(I)的化合物外,所述制剂还任选地包含其他农业化学活性化合物。

[0615] 优选包含以下物质的制剂或施用形式:助剂,例如增量剂、溶剂、自发性促进剂、载体、乳化剂、分散剂、防冻剂、灭生物剂、增稠剂;和/或其他助剂,例如佐剂。在本上下文中,佐剂为一种增强制剂的生物效应的组分,而该组分本身不具有任何生物效应。佐剂的实例为促进保持、铺展、对叶子表面的附着或渗透的试剂。

[0616] 这些制剂以已知的方式制备,例如通过将式(I)的化合物与助剂混合而制备,所述助剂例如增量剂、溶剂和/或固体载体和/或其他助剂,例如表面活性剂。所述制剂在合适的设施中制备或在施用前或施用期间制备。

[0617] 使用的助剂可为适于赋予式(I)的化合物的制剂或由这些制剂制备的施用形式(例如即用型农药如喷雾液体或拌种产品)特定特性(例如某些物理特性、技术特性和/或生物特性)的物质。

[0618] 合适的增量剂为,例如,水、极性和非极性有机化学液体,例如选自芳族烃类和非芳族烃类(例如石蜡、烷基苯、烷基萘、氯苯)、醇类和多元醇类(如果合适,其还可被取代、醚化和/或酯化)、酮类(例如丙酮、环己酮)、酯类(包括脂肪和油)和(聚)醚类、简单的和被取代的胺类、酰胺类、内酰胺类(例如N-烷基吡咯烷酮)以及内酯类、矾类和亚矾类(例如二甲基亚矾)。

[0619] 如果使用的增量剂为水,则还可使用例如有机溶剂作为助溶剂。有用的液体溶剂主要为:芳族化合物如二甲苯、甲苯或烷基萘,氯代芳族烃类或氯代脂族烃类如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷,脂族烃类如环己烷或石蜡,例如石油馏分、矿物油和植物油,醇类如丁醇或乙二醇及其醚类和酯类,酮类如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮,强极性溶剂如二甲基甲酰胺和二甲基亚矾,以及水。

[0620] 原则上,可使用所有合适的溶剂。合适的溶剂的实例为芳族烃类,例如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯代芳族烃类或氯代脂族烃类,例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃类,例如

环己烷、石蜡、石油馏分、矿物油和植物油；醇类，例如甲醇、乙醇、异丙醇、丁醇或乙二醇及其醚类和酯类；酮类，例如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮；强极性溶剂，例如二甲基亚砷，以及水。

[0621] 原则上，可使用所有合适的载体。合适的载体更具体而言包括以下物质：例如铵盐和细磨的天然岩石如高岭土、矾土、滑石、白垩、石英、绿坡缕石、蒙脱石或硅藻土以及细磨的合成岩石如高度分散的二氧化硅、氧化铝，以及天然或合成的硅酸盐、树脂、蜡和/或固体肥料。同样可使用这类载体的混合物。用于颗粒剂的可用的载体包括：例如粉碎并分级的天然岩石如方解石、大理石、浮石、海泡石、白云石和无机和有机粉末的合成颗粒，以及有机材料如锯屑、纸、椰壳、玉米穗轴和烟草茎的颗粒。

[0622] 还可使用液化的气态增量剂或溶剂。尤其合适的增量剂或载体为在标准温度和大气压力下为气态的那些增量剂或载体，例如气溶胶喷射剂如卤代烃类，以及丁烷、丙烷、氮气和二氧化碳。

[0623] 具有离子或非离子性质的乳化剂和/或发泡剂、分散剂或润湿剂或这些表面活性物质的混合物的实例为聚丙烯酸的盐、木素磺酸的盐、苯酚磺酸的盐或萘磺酸的盐、环氧乙烷与脂肪醇或与脂肪酸或与脂肪胺的缩聚物、环氧乙烷与取代的酚类（优选烷基酚或芳基酚）的缩聚物、磺基琥珀酸酯的盐、牛磺酸衍生物（优选牛磺酸烷基酯）、聚乙氧基化的醇类或酚类的磷酸酯、多元醇的脂肪酸酯，以及含有硫酸酯、磺酸酯和磷酸酯的化合物的衍生物，例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸酯、烷基硫酸酯、芳基磺酸酯、蛋白质水解产物、木素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。如果式 (I) 的化合物之一和/或惰性载体之一不溶于水且当施用在水中进行时，则表面活性剂的存在是有利的。

[0624] 可存在于制剂及由其获得的施用形式中的其他助剂包括染料如无机颜料，例如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝，以及有机染料如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料；以及维生素和微量营养素，例如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐。

[0625] 可存在的其他组分为稳定剂，例如低温稳定剂、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂或其他改善化学和/或物理稳定性的试剂。还可存在发泡剂 (foam generator) 或消泡剂。

[0626] 此外，所述制剂和由其获得的施用形式还可包含下列物质作为另外的助剂：粘着剂 (sticker) 如羧甲基纤维素以及粉末、颗粒或胶乳形式的天然和合成聚合物如阿拉伯树胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯，以及天然磷脂类如脑磷脂和卵磷脂以及合成磷脂类。其他助剂可为矿物油和植物油。

[0627] 如果合适，在所述制剂和由其获得的施用形式中还可存在其他助剂。这类添加剂的实例为香料、保护胶体、粘合剂、胶粘剂、增稠剂、触变剂、渗透剂、保持促进剂、稳定剂、螯合剂、络合组合物、保湿剂、铺展剂。通常，式 (I) 的化合物可与通常用于制剂目的的任何固体或液体添加剂结合。

[0628] 可用的保持促进剂包括所有降低动态表面张力的那些物质，例如磺基琥珀酸二辛酯；或所有增加粘弹性的那些物质，例如羟丙基瓜儿胶聚合物。

[0629] 在本上下文中，可用的渗透剂为所有通常用于改善农业化学活性化合物向植物渗透的那些物质。在本上下文中，渗透剂通过以下来定义：其从（通常为水性的）施用液体和/或从喷雾涂层渗入植物角质层并因此增加活性化合物在角质层中的移动性的能力。可使用文献 (Baur 等人, 1997, Pesticide Science 51, 131-152) 中记载的方法来测定此特性。实例

包括醇烷氧基化物如椰子脂肪乙氧基化物(10)或异十三烷基乙氧基化物(12);脂肪酸酯类,例如菜籽油甲酯或豆油甲酯;脂肪胺烷氧基化物,例如牛脂胺乙氧基化物(15);或铵盐和/或磷盐,例如硫酸铵或磷酸氢二铵。

[0630] 所述制剂优选包含在0.00000001重量%和98重量%之间的式(I)的化合物,更优选在0.01重量%和95重量%之间的式(I)的化合物,最优选在0.5重量%和90重量%之间的式(I)的化合物,基于制剂的重量计。

[0631] 在由所述制剂制备的施用形式(特别是农药)中,式(I)的化合物的含量可在宽范围内变化。在施用形式中,式(I)的化合物的浓度通常可为0.00000001重量%和95重量%之间的式(I)的化合物,优选在0.00001重量%和1重量%之间,基于施用形式的重量计。施用以适于施用形式的常规方式进行。

[0632] 混合物

[0633] 式(I)的化合物还可与一种或多种合适的以下物质以混合物的形式使用:杀真菌剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀软体动物剂、杀线虫剂、杀昆虫剂、微生物剂、有益生物、除草剂、肥料、驱鸟剂、植物性毒素(phytotonic)、止繁殖剂、安全剂、化学信息素和/或植物生长调节剂,从而由此例如扩大作用谱、延长作用周期、提高作用速率、防止抵抗性或防止耐药性的发展。此外,这类活性化合物结合物可改善植物生长和/或提高对非生物因素(例如高温或低温)的耐受性、对干旱或对高的水含量或土壤盐渍度的耐受性。还可改善开花和结果性能、优化发芽能力和根系发育、促进采收并提高产量、影响成熟、提高采收产品的质量和/或营养价值、延长采收产品的保存期限和/或改善采收产品的加工性能。

[0634] 此外,式(I)的化合物可与其他活性化合物或化学信息素如引诱剂和/或驱鸟剂和/或植物激活剂和/或生长调节剂和/或肥料以混合物的形式存在。同样地,式(I)的化合物还可用于改善植物性能,例如生长、采收物的产量和质量。

[0635] 在本发明的一个具体的实施方案中,在制剂或由这些制剂制备的施用形式中,式(I)的化合物与其他化合物、优选如下文所述的那些化合物以混合物的形式存在。

[0636] 如果下述化合物之一可以不同的互变异构形式存在,则这些形式也包括在内,即使在每种情况下没有明确提及。根据具体情况,如果混合组分基于它们的官能团能够与合适的碱或酸形成盐,则所有提及的混合组分也可与合适的碱或酸形成盐。

[0637] 杀昆虫剂/杀螨剂/杀线虫剂

[0638] 本文中以其通用名称说明的活性化合物是已知的并且记载于例如“The Pesticide Manual”(第16版,British Crop Protection Council 2012)中,或可在因特网(例如,<http://www.alanwood.net/pesticides>)上检索。所述分类基于在提交该专利申请时可适用的IRAC作用方式分类方案(the IRAC Mode of Action Classification Scheme)。

[0639] (1) 乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂,例如氨基甲酸酯类,例如棉铃威(alanycarb)、涕灭威(aldicarb)、恶虫威(bendiocarb)、丙硫克百威(benfuracarb)、丁酮威(butoxycarboxim)、丁酮砜威(butoxycarboxim)、甲萘威(carbaryl)、克百威(carbofuran)、丁硫克百威(carbosulfan)、乙硫苯威(ethiofencarb)、仲丁威(fenobucarb)、伐虫脒(formetanate)、呋线威(furathiocarb)、异丙威(isoprocarb)、甲硫威(methiocarb)、灭多威(methomyl)、速灭威(metolcarb)、杀线威(oxamyl)、抗蚜威(pirimicarb)、残杀威

(propoxur)、硫双威(thiodicarb)、久效威(thiofanox)、啉蚜威(triazamate)、混杀威(trimethacarb)、灭除威(XMC)和灭杀威(xylylcarb);或有机磷酸酯类,例如乙酰甲胺磷(acephate)、甲基吡啶磷(azamethiphos)、乙基谷硫磷(azinphos-ethyl)、甲基谷硫磷(azinphos-methyl)、硫线磷(cadusafos)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、毒虫畏(chlorfenvinphos)、氯甲硫磷(chlormephos)、甲基毒死蜱(chloropyrifos-methyl)、蝇毒磷(coumaphos)、杀螟腈(cyanophos)、甲基内吸磷(demeton-S-methyl)、二嗪农(diazinon)、敌敌畏(dichlorvos)/DDVP、百治磷(dicrotophos)、乐果(dimethoate)、甲基毒虫畏(dimethylvinphos)、乙拌磷(disulfoton)、苯硫磷(EPN)、乙硫磷(ethion)、灭线磷(ethoprophos)、伐灭磷(famphur)、苯线磷(fenamiphos)、杀螟硫磷(fenitrothion)、倍硫磷(fenthion)、噻唑膦(fosthiazate)、庚烯磷(heptenophos)、imicyafos、异柳磷(isofenphos)、0-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸异丙酯(isopropyl 0-(methoxyaminothiophosphoryl) salicylate)、异恶唑磷(isoxathion)、马拉松(malathion)、灭蚜磷(mecarbam)、甲胺磷(methamidophos)、杀扑磷(methidathion)、速灭磷(mevinphos)、久效磷(monocrotophos)、二溴磷(naled)、氧乐果(omethoate)、亚砷磷(oxydemeton-methyl)、甲基对硫磷(parathion-methyl)、稻丰散(phenthoate)、甲拌磷(phorate)、伏杀硫磷(phosalone)、亚胺硫磷(phosmet)、磷胺(phosphamidon)、辛硫磷(phoxim)、甲基嘧啶磷(pirimiphos-methyl)、丙溴磷(profenofos)、胺丙畏(propetamphos)、丙硫磷(prothiofos)、吡啶硫磷(pyraclufos)、吡啶硫磷(pyridaphenthion)、喹硫磷(quinalphos)、治螟磷(sulfotep)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、双硫磷(temephos)、特丁硫磷(terbufos)、杀虫畏(tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷(thiometon)、三唑磷(triazophos)、敌百虫(trichlorfon)和蚜灭磷(vamidothion)。

[0640] (2) GABA门控氯化物通道阻断剂,例如环戊二烯有机氯类,例如氯丹(chlordane)和硫丹(endosulfan),或苯基吡唑类(phenylpyrazoles, fiproles),例如乙虫腈(ethiprole)和氟虫腈(fipronil)。

[0641] (3) 钠通道调节剂,例如拟除虫菊酯类(pyrethroids),例如氟丙菊酯(acrinathrin)、丙烯菊酯(allethrin)、d-顺式-反式丙烯菊酯、d-反式丙烯菊酯、联苯菊酯(bifenthrin)、生物丙烯菊酯(bioallethrin)、生物丙烯菊酯S-环戊烯基同分异构体、生物苄呋菊酯(bioresmethrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、氟氯氰菊酯(cyfluthrin)、β-氟氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯(cyhalothrin)、λ-三氟氯氰菊酯、γ-三氟氯氰菊酯、氯氰菊酯(cypermethrin)、α-氯氰菊酯、β-氯氰菊酯、θ-氯氰菊酯、ζ-氯氰菊酯、苯醚氰菊酯[(1R)-反式同分异构体](cyphenothrin[(1R)-trans isomer])、溴氰菊酯(deltamethrin)、右旋烯炔菊酯[(EZ)-(1R)同分异构体](empenthrin[(EZ)-(1R) isomer])、高氰戊菊酯(esfenvalerate)、醚菊酯(etofenprox)、甲氰菊酯(fenpropathrin)、氰戊菊酯(fenvalerate)、氟氰戊菊酯(flucythrinate)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、τ-氟胺氰菊酯(tau-fluvalinate)、苄呋醚(halfenprox)、炔咪菊酯(imiprothrin)、噻噁菊酯(kadethrin)、momfluorothrin、氯菊酯(permethrin)、苯醚菊酯[(1R)-反式同分异构体](phenothrin[(1R)-trans isomer])、右旋烯炔丙菊酯(prallethrin)、除虫菊素(除虫菊)(pyrethrins (pyrethrum))、苄呋菊酯(resmethrin)、氟硅菊酯(silafluofen)、七氟菊酯

(tefluthrin)、胺菊酯(tetramethrin)、胺菊酯[(1R)同分异构体](tetramethrin[(1R) isomer])、四溴菊酯(tralomethrin)和四氟苯菊酯(transfluthrin),或滴滴涕(DDT),或甲氧滴滴涕(methoxychlor)。

[0642] (4) 烟碱能乙酰胆碱受体(nAChR)竞争调节剂,例如新烟碱类(neonicotinoids),例如啉虫脒(acetamiprid)、噻虫胺(clothianidin)、呋虫胺(dinotefuran)、吡虫啉(imidacloprid)、烯啉虫胺(nitenpyram)、噻虫啉(thiacloprid)和噻虫嗪(thiamethoxam),或烟碱(nicotine),或氟啉虫胺脒(sulfoxaflor),或氟吡呋喃酮(flupyradifurone)。

[0643] (5) 烟碱能乙酰胆碱受体(nAChR)变构调节剂,例如多杀菌素类(spinosyns),例如乙基多杀菌素(spinetoram)和多杀菌素(spinosad)。

[0644] (6) 谷氨酸酯门控氯化物通道(GluCl)变构调节剂,例如阿维菌素类(avermectins)/米尔倍霉素类(milbemycins),例如阿维菌素(abamectin)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐(emamectin benzoate)、雷皮菌素(lepimectin)和弥拜菌素(milbemectin)。

[0645] (7) 保幼激素模拟物,例如保幼激素类似物,例如烯虫乙酯(hydroprene)、烯虫炔酯(kinoprene)和烯虫酯(methoprene),或苯氧威(fenoxycarb),或吡丙醚(pyriproxyfen)。

[0646] (8) 多种非特异性(多位点)抑制剂,例如烷基卤化物类,例如甲基溴和其他烷基卤化物;或氯化苦(chloropicrin)或硫酰氟(sulphuryl fluoride)或硼砂(borax)或吐酒石(tartar emetic)或异氰酸甲酯发生剂,例如diazomet和威百亩(metam)。

[0647] (9) 弦音器官(chordotonal organ)调节剂,例如吡蚜酮(pymetrozine),或氟啉虫酰胺(flonicamide)。

[0648] (10) 螨生长抑制剂,例如四螨嗪(clofentezine)、噻螨酮(hexythiazox)和氟螨嗪(diflovidazin),或乙螨唑(etoxazole)。

[0649] (11) 昆虫中肠膜微生物干扰剂,例如苏云金芽孢杆菌以色列亚种(*Bacillus thuringiensis* subspecies *israelensis*)、球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus*)、苏云金芽孢杆菌鮎泽亚种(*Bacillus thuringiensis* subspecies *aizawai*)、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(*Bacillus thuringiensis* subspecies *kurstaki*)、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种(*Bacillus thuringiensis* subspecies *tenebrionis*)和B.t植物蛋白:Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、VIP3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/35Ab1。

[0650] (12) 线粒体ATP合酶抑制剂,例如ATP干扰剂,例如丁醚脲(diafenthiuron),或有机锡化合物类,例如三唑锡(azocyclotin)、三环锡(cyhexatin)和苯丁锡(fenbutatin oxide),或炔螨特(propargite),或四氯杀螨砒(tetradifon)。

[0651] (13) 通过间断质子梯度作用的氧化磷酸化解偶联剂,例如溴虫脒(chlorfenapyr)、二硝甲酚(DNOC)和氟虫胺(sulfluramid)。

[0652] (14) 烟碱能乙酰胆碱受体通道阻断剂,例如杀虫磺(bensultap)、杀螟丹盐酸盐(cartap hydrochloride)、杀虫环(thiocyclam)和杀虫双(thiosultap-sodium)。

[0653] (15) 0型几丁质生物合成抑制剂,例如双三氟虫脒(bistrifluron)、定虫隆(chlorfluazuron)、二氟脒(diflubenzuron)、氟环脒(flucycloxuron)、氟虫脒(flufenoxuron)、氟铃脒(hexaflumuron)、虱螨脒(lufenuron)、氟酰脒(novaluron)、多氟

脲(noviflumuron)、氟苯脲(teflubenzuron)和杀铃脲(triflumuron)。

[0654] (16) 1型几丁质生物合成抑制剂,例如噻嗪酮(buprofezin)。

[0655] (17) 蜕皮干扰剂(尤其是对于双翅目),例如灭蝇胺(cyromazine)。

[0656] (18) 蜕皮激素受体激动剂,例如环虫酰肼(chromafenozide)、氯虫酰肼(halofenozide)、甲氧虫酰肼(methoxyfenozide)和虫酰肼(tebufenozide)。

[0657] (19) 章鱼胺受体激动剂,例如双甲脒(amitraz)。

[0658] (20) 线粒体复合物III电子传递抑制剂,例如氟蚁腓(hydramethylnon)或灭螨醌(acequinocyl)或噁螨酯(flucrypyrim)。

[0659] (21) 线粒体复合物I电子传递抑制剂,例如METI杀螨剂类,例如喹螨醚(fenazaquin)、唑螨酯(fenpyroximate)、噁螨醚(pyrimidifen)、吡啶灵(pyridaben)、吡螨胺(tebufenpyrad)和唑虫酰胺(tolfenpyrad),或鱼藤酮(rotenone)(鱼藤属(Derris))。

[0660] (22) 电压依赖型钠通道阻断剂,例如茚虫威(indoxacarb)或氰氟虫脒(metaflumizone)。

[0661] (23) 乙酰基辅酶A(CoA)羧化酶抑制剂,例如特窗酸和特特拉姆酸(tetramic acid)衍生物,例如螺螨酯(spirodiclofen)、螺甲螨酯(spiromesifen)和螺虫乙酯(spirotetramat)。

[0662] (24) 线粒体复合物IV电子传递抑制剂,例如膦类化合物,例如磷化铝、磷化钙、膦和磷化锌,或氰化物类,氰化钙、氰化钾和氰化钠。

[0663] (25) 线粒体复合物II电子传递抑制剂,例如β-酮腈衍生物类(beta-keto nitrile derivatives),例如腈吡螨酯(cyenopyrafen)和丁氟螨酯(cyflumetofen)和carboxanilide,例如pyflubumide。

[0664] (28) 兰尼碱(ryanodine)受体调节剂,例如二酰胺类,例如氯虫苯甲酰胺(chlorantraniliprole)、氰虫酰胺(cyantraniliprole)和氟虫双酰胺(flubendiamide),

[0665] 其他活性化合物,例如啉喃环丙虫酯(afidopyropen)、阿福拉纳(afoxolaner)、印楝素(azadirachtin)、benclouthiaz、苯螨特(benzoximate)、联苯肼酯(bifenazate)、溴虫氟苯双酰胺(broflanilide)、溴螨酯(bromopropylate)、灭螨猛(chinomethionat)、氯丙炔菊酯(chloroprallethrin)、冰晶石(cryolite)、环溴虫酰胺(cyclaniliprole)、环氧虫啉(cyclozaprid)、氯氟氰虫酰胺(cyhalodiamide)、dicloromezotiaz、三氯杀螨醇(dicofol)、ε-甲氧苄氟菊酯(epsilon metofluthrin)、epsilon momfluthrin、flometoquin、fluazaindolizine、联氟砒(flusulfone)、噁虫胺(flufenimer)、氟菌螨酯(flufenoxystrobin)、丁虫腈(flufiprole)、fluhexafon、氟吡菌酰胺(flupyram)、氟雷拉纳(fluralaner)、fluxametamide、呋喃虫酰肼(fufenozide)、戊吡虫胍(guadipyr)、heptafluthrin、氯噻啉(imidaclothiz)、异菌脲(iprodione)、κ-联苯菊酯(kappa bifenthrin)、κ-七氟菊酯(kappa tefluthrin)、lotilaner、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、哌虫啉(paichongding)、啉虫丙醚(pyridalyl)、pyrifluquinazon、噁螨胺(pyriminostrobin)、spirobudiclofen、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)、氟氰虫酰胺(tetraniliprole)、四氯虫酰胺(tetrachlorantraniliprole)、tioxazafen、硫氟脲酯(thiofluoimate)、三氟苯噁啉(triflumezopyrim)和碘甲烷(iodomethane);另外基于坚强芽孢杆菌(Bacillus firmus)(I-1582,BioNeem,Votivo)的制剂,和下列化合物:1-{2-

氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亚磺酰基]苯基}-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺(由W02006/043635获知)(CAS 885026-50-6)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吡啶-3,4'-哌啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮(由W02003/106457获知)(CAS 637360-23-7)、2-氯-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]哌啶-4-基}-4-(三氟甲基)苯基]异烟酰胺(由W02006/003494获知)(CAS 872999-66-1)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-4-羟基-8-甲氧基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(由W0 2010052161获知)(CAS 1225292-17-0)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基碳酸乙酯(由EP 2647626获知)(CAS-1440516-42-6)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基哌啶-1-基)-5-氟嘧啶(由W02004/099160获知)(CAS 792914-58-0)、PF1364(由JP2010/018586获知)(CAS登记号1204776-60-2)、N-[(2E)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]吡啶-2(1H)-亚基]-2,2,2-三氟乙酰胺(由W02012/029672获知)(CAS 1363400-41-2)、(3E)-3-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-吡啶亚基]-1,1,1-三氟丙-2-酮(由W02013/144213获知)(CAS 1461743-15-6)、N-[3-(苄基氨基甲酰基)-4-氯苯基]-1-甲基-3-(五氟乙基)-4-(三氟甲基)-1H-吡啶-5-甲酰胺(由W02010/051926获知)(CAS 1226889-14-0)、5-溴-4-氯-N-[4-氯-2-甲基-6-(甲基氨基甲酰基)苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)吡啶-3-甲酰胺(由CN103232431获知)(CAS 1449220-44-3)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-甲基-N-(顺式-1-氧化-3-硫杂环丁基)苯甲酰胺、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-甲基-N-(反式-1-氧化-3-硫杂环丁基)苯甲酰胺和4-[5(S)-5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-甲基-N-(顺式-1-氧化-3-硫杂环丁基)苯甲酰胺(由W0 2013/050317 A1获知)(CAS 1332628-83-7)、N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡啶-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亚磺酰基]丙酰胺、(+)-N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡啶-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亚磺酰基]丙酰胺和(-)-N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡啶-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亚磺酰基]丙酰胺(由W0 2013/162715 A2、W0 2013/162716 A2、US 2014/0213448 A1获知)(CAS 1477923-37-7)、5-[[[(2E)-3-氯-2-丙烯-1-基]氨基]-1-[2,6-二氯-4-(三氟甲基)苯基]-4-[(三氟甲基)亚磺酰基]-1H-吡啶-3-甲腈(由CN 101337937 A获知)(CAS 1105672-77-2)、3-溴-N-[4-氯-2-甲基-6-[(甲基氨基)硫氧代甲基]苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡啶-5-甲酰胺、(Liudaibenjiaxuanan,由CN 103109816 A获知)(CAS 1232543-85-9);N-[4-氯-2-[[[(1,1-二甲基乙基)氨基]羰基]-6-甲基苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(氟甲氧基)-1H-吡啶-5-甲酰胺(由W0 2012/034403 A1获知)(CAS 1268277-22-0)、N-[2-(5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡啶-5-甲酰胺(由W0 2011/085575 A1获知)(CAS 1233882-22-8)、4-[3-[2,6-二氯-4-[(3,3-二氯-2-丙烯-1-基)氧基]苯氧基]丙氧基]-2-甲氧基-6-(三氟甲基)嘧啶(由CN 101337940 A获知)(CAS 1108184-52-6);(2E)-2-[2-(4-氰基苯基)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]-N-[4-(二氟甲氧基)苯基]肼甲酰胺和2(Z)-2-[2-(4-氰基苯基)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]-N-[4-(二氟甲氧基)苯基]肼甲酰胺(由CN 101715774 A获知)(CAS 1232543-85-9);环丙烷甲酸3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基-4-(1H-苯并咪唑-2-基)苯酯(由CN 103524422 A获知)(CAS 1542271-46-4);(4aS)-7-氯-2,5-二氢-2-[[[(甲氧基羰基)[4-[(三氟甲基)硫代]苯基]氨基]羰基]茛并[1,2-e][1,3,4]噁二嗪-4a(3H)-甲酸甲酯(由CN 102391261 A获知)

(CAS 1370358-69-2);6-脱氧-3-O-乙基-2,4-二-O-甲基-1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-五氟乙氧基)苯基]-1H-1,2,4-三唑-3-基]苯基]氨基甲酸酯]- α -L-吡喃甘露糖(由US 2014/0275503 A1获知)(CAS 1181213-14-8);8-(2-环丙基甲氧基-4-三氟甲基苯氧基)-3-(6-三氟甲基哒嗪-3-基)-3-氮杂二环[3.2.1]辛烷(CAS 1253850-56-4)、(8-反式)-8-(2-环丙基甲氧基-4-三氟甲基苯氧基)-3-(6-三氟甲基哒嗪-3-基)-3-氮杂二环[3.2.1]辛烷(CAS 933798-27-7)、(8-顺式)-8-(2-环丙基甲氧基-4-三氟甲基苯氧基)-3-(6-三氟甲基哒嗪-3-基)-3-氮杂二环[3.2.1]辛烷(由WO 2007040280 A1、WO 2007040282 A1获知)(CAS 934001-66-8)、N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)硫代]丙酰胺(由WO 2015/058021 A1、WO 2015/058028 A1获知)(CAS 1477919-27-9)和N-[4-(氨基硫氧代甲基)-2-甲基-6-[(甲基氨基)羰基]苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-甲酰胺(由CN 103265527 A获知)(CAS 1452877-50-7)。

[0666] 杀真菌剂

[0667] 本文中以其通用名称说明的活性化合物是已知的并且记载于例如“Pesticide Manual”(第16版, British Crop Protection Council)中或可在因特网(例如:<http://www.alanwood.net/pesticides>)上检索。

[0668] 根据具体情况,如果混合组分基于其官能团能够与合适的碱或酸形成盐,则在(1)至(15)类中提及的所有混合组分可与合适的碱或酸形成盐。根据具体情况,所有在(1)至(15)类中提及的杀真菌混合组分可包括互变异构形式。

[0669] 1) 麦角固醇生物合成抑制剂,例如(1.001)环丙唑醇(cyproconazole)、(1.002)苯醚甲环唑(difenoconazole)、(1.003)氟环唑(epoxiconazole)、(1.004)环酰菌胺(fenhexamid)、(1.005)苯锈啶(fenpropidine)、(1.006)丁苯吗啉(fenpropimorph)、(1.007)胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)、(1.008)氟喹唑(flquinconazole)、(1.009)粉唑醇(flutriafol)、(1.010)抑霉唑(imazalil)、(1.011)抑霉唑硫酸盐(imazalil sulfate)、(1.012)种菌唑(ipconazole)、(1.013)叶菌唑(metconazole)、(1.014)腈菌唑(myclobutanil)、(1.015)多效唑(paclobutrazol)、(1.016)咪鲜胺(prochloraz)、(1.017)丙环唑(propiconazole)、(1.018)丙硫菌唑(prothioconazole)、(1.019)啉菌恶唑(pyrisoxazole)、(1.020)螺环菌胺(spiroxamine)、(1.021)戊唑醇(tebuconazole)、(1.022)四氟醚唑(tetraconazole)、(1.023)三唑醇(triadimenol)、(1.024)十三吗啉(tridemorph)、(1.025)灭菌唑(triticonazole)、(1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇、(1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇、(1.028) (2R)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.029) (2R)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.030) (2R)-2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.031) (2S)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.032) (2S)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.033) (2S)-2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.034) (R)-[3-(4-氯-2-氟苄基)-5-(2,4-二氟苄基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.035) (S)-[3-(4-氯-2-氟苄基)-5-(2,4-二氟苄基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-

基) 甲醇、(1.036) [3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基] (吡啶-3-基) 甲醇、(1.037) 1-({(2R,4S)-2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-4-甲基-1,3-二氧戊环-2-基} 甲基)-1H-1,2,4-三唑、(1.038) 1-({(2S,4S)-2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-4-甲基-1,3-二氧戊环-2-基} 甲基)-1H-1,2,4-三唑、(1.039) 1-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.040) 1-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.041) 1-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.050) 2-[1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.051) 2-[2-氯-4-(2,4-二氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.052) 2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.053) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.054) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)戊-2-醇、(1.055) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.056) 2-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.057) 2-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.058) 2-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.059) 5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇、(1.060) 5-(烯丙基硫烷基)-1-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(1.061) 5-(烯丙基硫烷基)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(1.062) 5-(烯丙基硫烷基)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(1.063) N'-(2,5-二甲基-4-[[3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]硫烷基]苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.064) N'-(2,5-二甲基-4-[[3-(2,2,2-三氟乙氧基)苯基]硫烷基]苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.065) N'-(2,5-二甲基-4-[[3-(2,2,3,3-四氟丙氧基)苯基]硫烷基]苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.066) N'-(2,5-二甲基-4-[[3-(五氟乙氧基)苯基]硫烷基]苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.067) N'-(2,5-二甲基-4-[[3-[(1,1,2,2-四氟乙基)硫烷基]苯氧基]苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.068) N'-(2,5-二甲基-4-[[3-[(2,2,2-三氟乙基)硫烷基]苯氧基]苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、

(1.069) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(2,2,3,3-四氟丙基)硫烷基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.070) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(五氟乙基)硫烷基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.071) N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.072) N'-(4-{[3-(二氟甲氧基)苯基]硫烷基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.073) N'-(4-{3-[(二氟甲基)硫烷基]苯氧基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.074) N'-[5-溴-6-(2,3-二氢-1H-茛-2-基氧基)-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.075) N'-{4-[(4,5-二氯-1,3-噻唑-2-基)氧基]-2,5-二甲基苯基}-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.076) N'-{5-溴-6-[(1R)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.077) N'-{5-溴-6-[(1S)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.078) N'-{5-溴-6-[(顺式-4-异丙基环己基)氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.079) N'-{5-溴-6-[(反式-4-异丙基环己基)氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.080) N'-{5-溴-6-[1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.081) mefentrifluconazole、(1.082) ipfentrifluconazole。

[0670] 2) 呼吸链复合物I或II抑制剂,例如(2.001) 苯并烯氟菌唑(benzovindiflupyr)、(2.002) 联苯吡菌胺(bixafen)、(2.003) 啉酰菌胺(boscalid)、(2.004) 萎锈灵(carboxin)、(2.005) 氟吡菌酰胺(fluopyram)、(2.006) 氟酰胺(flutolanil)、(2.007) 氟唑菌酰胺(fluxapyroxad)、(2.008) 呋吡菌胺(furametpyr)、(2.009) 异丙噻菌胺(isofetamid)、(2.010) 吡唑萘菌胺(isopyrazam)(反式差向异构对映体1R,4S,9S)、(2.011) 吡唑萘菌胺(反式差向异构对映体1S,4R,9R)、(2.012) 吡唑萘菌胺(反式差向异构外消旋体1RS,4SR,9SR)、(2.013) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构外消旋体1RS,4SR,9RS与反式差向异构外消旋体1RS,4SR,9SR的混合物)、(2.014) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构对映体1R,4S,9R)、(2.015) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构对映体1S,4R,9S)、(2.016) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构外消旋体1RS,4SR,9RS)、(2.017) 戊苯吡菌胺(penflufen)、(2.018) 吡噻菌胺(penthiopyrad)、(2.019) 氟唑菌酰羟胺(pydiflumetofen)、(2.020) pyraziflumid、(2.021) 氟唑环菌胺(sedaxane)、(2.022) 1,3-二甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.023) 1,3-二甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.024) 1,3-二甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.025) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[2'-(三氟甲基)联苯-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.026) 2-氟-6-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)苯甲酰胺、(2.027) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.028) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.029) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.030) 3-(二氟甲基)-N-(7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.031) 3-(二氟甲基)-N-[(3R)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.032) 3-(二氟甲基)-N-[(3S)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.033) 5,8-二氟-N-[2-(2-氟-4-{[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]氧基}苯基)乙基]喹唑啉-4-胺、(2.034) N-

(2-环戊基-5-氟苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.035)N-(2-叔丁基-5-甲基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.036)N-(2-叔丁基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.037)N-(5-氯-2-乙基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.038)N-(5-氯-2-异丙基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.039)N-[(1R,4S)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-桥亚甲基萘(methanonaphthalin)-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.040)N-[(1S,4R)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-桥亚甲基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.041)N-[1-(2,4-二氯苄基)-1-甲氧基丙-2-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.042)N-[2-氯-6-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.043)N-[3-氯-2-氟-6-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.044)N-[5-氯-2-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.045)N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-N-[5-甲基-2-(三氟甲基)苄基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.046)N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-氟-6-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.047)N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基-5-甲基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.048)N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-硫代甲酰胺、(2.049)N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.050)N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(5-氟-2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.051)N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-4,5-二甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.052)N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-氟苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.053)N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.054)N-环丙基-N-(2-环丙基-5-氟苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.055)N-环丙基-N-(2-环丙基-5-甲基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.056)N-环丙基-N-(2-环丙基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺。

[0671] 3)呼吸链复合物III抑制剂,例如(3.001)啞啞菌胺(ametoctradin)、(3.002)安美速(amisulbrom)、(3.003)啞菌酯(azoxystrobin)、(3.004)甲香菌酯(coumethoxystrobin)、(3.005)丁香菌酯(coumoxystrobin)、(3.006)氰霜啞(cyazofamid)、(3.007)啞菌胺(dimoxystrobin)、(3.008)烯肱菌酯(enoxastrobin)、(3.009)恶啞菌酮(famoxadon)、(3.010)咪啞菌酮(fenamidon)、(3.011)氟菌蟊酯(flufenoxystrobin)、(3.012)氟啞菌酯(fluxastrobin)、(3.013)啞菌酯(kresoxim-methyl)、(3.014)苯氧菌胺(metominostrobin)、(3.015)肱啞菌胺(oryastrobin)、(3.016)啞氧菌酯(picoxystrobin)、(3.017)啞菌胺酯(pyraclostrobin)、(3.018)啞胺菌酯(pyrametostrobin)、(3.019)啞菌酯(pyraoxystrobin)、(3.020)肱菌酯(trifloxystrobin)、(3.021)(2E)-2-{2-[[[(1E)-1-(3-[[E)-1-氟-2-苄基乙基]氧基]苄基)亚乙基]氨基]氧基]甲基]苄基}-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、(3.022)(2E,3Z)-5-[[1-(4-氯苄基)-1H-吡唑-3-基]氧基]-2-(甲氧基亚氨基)-N,3-二甲基戊-3-烯酰胺、(3.023)(2R)-2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苄基}-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺、

(3.024) (2S)-2-[2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基]-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺、(3.025) (3S,6S,7R,8R)-8-苄基-3-[(3-[(异丁酰氧基)甲氧基]-4-甲氧基吡啶-2-基)羰基]氨基]-6-甲基-4,9-二氧代-1,5-二氧杂环壬烷-7-基-2-甲基丙酸酯、(3.026) 2-[2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基]-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺、(3.027) N-(3-乙基-3,5,5-三甲基环己基)-3-甲酰氨基-2-羟基苯甲酰胺、(3.028) (2E,3Z)-5-{[1-(4-氯-2-氟苯基)-1H-吡唑-3-基]氧基}-2-(甲氧基亚氨基)-N,3-二甲基戊-3-烯酰胺、(3.029) {5-[3-(2,4-二甲基苯基)-1H-吡唑-1-基]-2-甲基苄基}氨基甲酸甲酯。

[0672] 4) 有丝分裂和细胞分裂抑制剂,例如(4.001)多菌灵(carbendazim)、(4.002)乙霉威(diethofencarb)、(4.003)噻唑菌胺(ethaboxam)、(4.004)氟吡菌胺(fluopicolid)、(4.005)戊菌隆(pencycuron)、(4.006)噻菌灵(thiabendazole)、(4.007)甲基硫菌灵(thiophanate-methyl)、(4.008)苯酰菌胺(zoxamide)、(4.009)3-氯-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基-5-苯基哒嗪、(4.010)3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基哒嗪、(4.011)3-氯-5-(6-氯吡啶-3-基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)哒嗪、(4.012)4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.013)4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.014)4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.015)4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.016)4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.017)4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.018)4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.019)4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.020)4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.021)4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.022)4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基哒嗪、(4.023) N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.024) N-(2-溴苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.025) N-(4-氯-2,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺。

[0673] 5) 具有多位点活性能力的化合物,例如(5.001)波尔多混合剂(Bordeaux mixture)、(5.002)敌菌丹(captafol)、(5.003)克菌丹(captan)、(5.004)百菌清(chlorothalonil)、(5.005)氢氧化铜、(5.006)环烷酸铜、(5.007)氧化铜、(5.008)氯氧化铜、(5.009)硫酸铜(2+)、(5.010)二氰蒽醌(dithianon)、(5.011)多果定(dodin)、(5.012)灭菌丹(folpet)、(5.013)代森锰锌(mancozeb)、(5.014)代森锰(maneb)、(5.015)代森联(metiram)、(5.016)代森联锌(zinc metiram)、(5.017)羟基喹啉铜(copper oxine)、(5.018)甲基代森锌(propineb)、(5.019)包括多硫化钙的硫和硫制剂、(5.020)福美双(thiram)、(5.021)代森锌(zineb)、(5.022)福美锌(ziram)、(5.023)6-乙基-5,7-二氧代-6,7-二氢-5H-吡咯并[3',4':5,6][1,4]二噻英并[2,3-c][1,2]噻唑-3-甲腈。

[0674] 6) 能引发宿主防御的化合物,例如(6.001)苯并噻二唑(acibenzolar-S-methyl)、(6.002)异噻菌胺(isotianil)、(6.003)烯丙苯噻唑(probenazole)、(6.004)噻酰菌胺(tiadinil)。

[0675] 7) 氨基酸和/或蛋白质生物合成抑制剂,例如(7.001)啞菌环胺(cyprodinil)、(7.002)春雷霉素(kasugamycin)、(7.003)春雷霉素盐酸盐水合物(kasugamycin

hydrochloride hydrate)、(7.004) 氧四环素(oxytetracycline)、(7.005) 嘧霉胺(pyrimethanil)、(7.006) 3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉。

[0676] 8) ATP产生抑制剂,例如(8.001) 硅噻菌胺(silthiofam)。

[0677] 9) 细胞壁合成抑制剂,例如(9.001) 苯噻菌胺(benthiavalicarb)、(9.002) 烯酰吗啉(dimethomorph)、(9.003) 氟吗啉(flumorph)、(9.004) 异丙菌胺(iprovalicarb)、(9.005) 双炔酰菌胺(mandipropamid)、(9.006) 吡吗啉(pyrimorph)、(9.007) 霜霉灭(valifenalate)、(9.008) (2E)-3-(4-叔丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(吗啉-4-基)丙-2-烯-1-酮、(9.009) (2Z)-3-(4-叔丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(吗啉-4-基)丙-2-烯-1-酮。

[0678] 10) 脂质和膜合成抑制剂,例如(10.001) 霜霉威(propamocarb)、(10.002) 霜霉威盐酸盐(propamocarb hydrochloride)、(10.003) 甲基立枯磷(tolclofos-methyl)。

[0679] 11) 黑色素生物合成抑制剂,例如(11.001) 三环唑(tricyclazole)、(11.002) 2,2,2-三氟乙基{3-甲基-1-[(4-甲基苯甲酰基)氨基]丁-2-基}氨基甲酸酯。

[0680] 12) 核酸合成抑制剂,例如(12.001) 苯霜灵(benalaxyl)、(12.002) 精苯霜灵(benalaxyl-M)(kiralaxyl)、(12.003) 甲霜灵(metalaxyl)、(12.004) 高效甲霜灵(metalaxyl-M)(精甲霜灵(mefenoxam))。

[0681] 13) 信号转导抑制剂,例如(13.001) 咯菌腈(fludioxonil)、(13.002) 异菌脲(iprodione)、(13.003) 腐霉利(procymidone)、(13.004) 丙氧喹啉(proquinazid)、(13.005) 喹氧灵(quinoxifen)、(13.006) 乙烯菌核利(vinclozolin)。

[0682] 14) 可用作解偶联剂的化合物,例如(14.001) 氟啶胺(fluzinam)、(14.002) 消螨多(meptyldinocap)。

[0683] 15) 其他化合物,例如(15.001) 脱落酸(abscisic acid)、(15.002) 苯噻硫氰(benthiazole)、(15.003) bethoxazine、(15.004) 卡巴西霉素(capsimycin)、(15.005) 香芹酮(carvone)、(15.006) 灭螨猛(chinomethionat)、(15.007) 硫杂灵(cufraneb)、(15.008) 环氟菌胺(cyflufenamid)、(15.009) 霜脲氰(cymoxanil)、(15.010) 环丙磺酰胺(cyprosulfamide)、(15.011) flutianil、(15.012) 三乙膦酸铝(fosetyl-aluminium)、(15.013) 三乙膦酸钙(fosetyl-calcium)、(15.014) 三乙膦酸钠(fosetyl-sodium)、(15.015) 异硫氰酸甲酯(methyl isothiocyanate)、(15.016) 苯菌酮(metrafenone)、(15.017) 米多霉素(mildiomyacin)、(15.018) 纳他霉素(natamycin)、(15.019) 福美镍(nickel dimethyldithiocarbamate)、(15.020) 酞菌酯(nitrothal-isopropyl)、(15.021) oxamocarb、(15.022) 氟噻唑吡乙酮(oxathiapiproline)、(15.023) oxyfenthiine、(15.024) 五氯苯酚及其盐、(15.025) 膦酸及其盐、(15.026) 霜霉威乙膦酸盐(propamocarb-fosetylalate)、(15.027) pyriofenone(chlazafenone)、(15.028) 异丁乙氧喹啉(tebufloquin)、(15.029) 叶枯酞(tecloftalam)、(15.030) 甲磺菌胺(tolnifanide)、(15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(15.033) 2-(6-苄基吡啶-2-基)喹啉、(15.034) 2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二噻英并[2,3-c:5,6-c']联吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮、(15.035) 2-

[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-丙-2-炔-1-基氧基]苯基}-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基)-1,3-噻唑-2-基]哌啶-1-基]乙酮、(15.036) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基)-1,3-噻唑-2-基]哌啶-1-基]乙酮、(15.037) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基)-1,3-噻唑-2-基]哌啶-1-基]乙酮、(15.038) 2-[6-(3-氟-4-甲氧基苯基)-5-甲基吡啶-2-基]喹唑啉、(15.039) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基}-3-氯苯基甲磺酸酯、(15.040) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基}-3-氯苯基甲磺酸酯、(15.041) 2-{2-[(7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基)氧基]-6-氟苯基}丙-2-醇、(15.042) 2-{2-氟-6-[(8-氟-2-甲基喹啉-3-基)氧基]苯基}丙-2-醇、(15.043) 2-{3-[2-(1-{[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基}-3-氯苯基甲磺酸酯、(15.044) 2-{3-[2-(1-{[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基}苯基甲磺酸酯、(15.045) 2-苯基苯酚及其盐、(15.046) 3-(4,4,5-三氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉、(15.047) 3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉、(15.048) 4-氨基-5-氟嘧啶-2-醇(互变异构形式:4-氨基-5-氟嘧啶-2(1H)-酮)、(15.049) 4-氧代-4-[(2-苄基)氨基]丁酸、(15.050) 5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇、(15.051) 5-氯-N'-苄基-N'-(丙-2-炔-1-基)噻吩-2-磺酰肼、(15.052) 5-氟-2-[(4-氟苄基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.053) 5-氟-2-[(4-甲基苄基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.054) 9-氟-2,2-二甲基-5-(喹啉-3-基)-2,3-二氢-1,4-苯并氧杂吡庚因、(15.055) 丁-3-炔-1-基{6-[(Z)-(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基}氧基}甲基]吡啶-2-基}氨基甲酸酯、(15.056) (2Z)-3-氨基-2-氰基-3-苯基丙烯酸乙酯、(15.057) 吩嗪-1-甲酸、(15.058) 3,4,5-三羟基苯甲酸丙酯、(15.059) 喹啉-8-醇、(15.060) 喹啉-8-醇硫酸酯(2:1)、(15.061) {6-[(Z)-(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基}氧基}甲基]吡啶-2-基}氨基甲酸叔丁酯、(15.062) 5-氟-4-亚氨基-3-甲基-1-[(4-甲基苄基)磺酰基]-3,4-二氢嘧啶-2(1H)-酮。

[0684] 作为混合组分的生物农药

[0685] 式(I)的化合物可与生物农药结合。

[0686] 生物农药尤其包括细菌、真菌、酵母、植物提取物和由微生物形成的产物,包括蛋白质和次生代谢物。

[0687] 生物农药包括细菌,例如形成孢子的细菌、根部定殖细菌和用作生物杀昆虫剂、杀真菌剂或杀线虫剂的细菌。

[0688] 用作或可用作生物农药的这类细菌的实例为:

[0689] 解淀粉芽孢杆菌(*Bacillus amyloliquefaciens*),菌株FZB42(DSM 231179),或蜡样芽孢杆菌(*Bacillus cereus*),尤其是蜡样芽孢杆菌菌株CNCM I-1562,或坚强芽孢杆菌,菌株I-1582(登记号CNCM I-1582),或短小芽孢杆菌(*Bacillus pumilus*),尤其是菌株GB34(登记号ATCC 700814)和菌株QST2808(登记号NRRL B-30087),或枯草芽孢杆菌(*Bacillus subtilis*),尤其是菌株GB03(登记号ATCC SD-1397),或枯草芽孢杆菌菌株QST713(登记号

NRRL B-21661) 或枯草芽孢杆菌菌株OST 30002 (登记号NRRL B-50421), 苏云金芽孢杆菌 (*Bacillus thuringiensis*), 尤其是苏云金芽孢杆菌以色列亚种 (血清型H-14), 菌株AM65-52 (登记号ATCC 1276), 或苏云金芽孢杆菌鲎泽亚种, 尤其是菌株ABTS-1857 (SD-1372), 或苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种菌株HD-1, 或苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种菌株NB 176 (SD-5428), 穿刺芽孢杆菌 (*Pasteuria penetrans*), 巴斯德氏芽菌属 (*Pasteuria* spp.) (肾形线虫 (*Rotylenchulus reniformis* nematode)) -PR3 (登记号ATCC SD-5834), 细黄链霉菌 (*Streptomyces microflavus*) 菌株AQ6121 (=QRD 31.013, NRRL B-50550), 鲜黄链霉菌 (*Streptomyces galbus*) 菌株AQ 6047 (登记号NRRL 30232)。

[0690] 用作或可用作生物农药的真菌和酵母的实例为:

[0691] 球孢白僵菌 (*Beauveria bassiana*), 特别是菌株ATCC 74040, 盾壳霉 (*Coniothyrium minitans*), 特别是菌株CON/M/91-8 (登记号DSM-9660), 蜡蚧菌属 (*Lecanicillium* spp.), 特别是菌株HR0 LEC 12, 蜡蚧轮枝菌 (*Lecanicillium lecanii*), (先前称为蜡蚧轮枝孢 (*Verticillium lecanii*)), 特别是菌株KV01, 绿僵菌 (*Metarhizium anisopliae*), 特别是菌株F52 (DSM3884/ATCC 90448), 核果梅奇酵母 (*Metschnikowia fructicola*), 特别是菌株NRRL Y-30752, 玫烟色拟青霉 (*Paecilomyces fumosoroseus*) (现用名: 玫烟色棒束孢 (*Isaria fumosorosea*)), 特别是菌株IFPC 200613 或菌株Apopka 97 (登记号ATCC 20874), 淡紫色拟青霉 (*Paecilomyces lilacinus*), 特别是淡紫色拟青霉菌株251 (AGAL 89/030550), 黄色蠕形霉 (*Talaromyces flavus*), 特别是菌株V117b, 深绿木霉 (*Trichoderma atroviride*), 特别是菌株SC1 (登记号CBS 122089), 哈茨木霉 (*Trichoderma harzianum*), 特别是哈茨木霉 (*T.harzianum rifai*) T39 (登记号CNCM I-952)。

[0692] 用作或可用作生物农药的病毒的实例为:

[0693] 棉褐带卷蛾 (*Adoxophyes orana*) (夏季水果卷叶蛾 (summer fruit tortrix)) 颗粒体病毒 (GV)、苹果蠹蛾 (*Cydia pomonella*) (codling moth) 颗粒体病毒 (GV)、棉铃虫 (*Helicoverpa armigera*) (cotton bollworm) 核多角体病毒 (NPV)、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua*) (beet armyworm) mNPV、草地贪夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*) (fall armyworm) mNPV、海灰翅夜蛾 (*Spodoptera littoralis*) (非洲棉叶虫 (African cotton leafworm)) NPV。

[0694] 还包括作为“接种菌”添加到植物或植物部位或植物器官并凭借其特定性能促进植物生长和植物健康的细菌和真菌。实例包括:

[0695] 土壤杆菌属 (*Agrobacterium* spp.), 茎瘤固氮根瘤菌 (*Azorhizobium caulinodans*), 固氮螺菌属 (*Azospirillum* spp.), 固氮菌属 (*Azotobacter* spp.), 慢生根瘤菌属 (*Bradyrhizobium* spp.), 伯克霍尔德菌属 (*Burkholderia* spp.), 尤其是洋葱伯克霍尔德菌 (*Burkholderia cepacia*) (先前称为洋葱假单胞菌 (*Pseudomonas cepacia*)), 巨孢囊霉属 (*Gigaspora* spp.) 或 *Gigaspora monosporum*, 球囊霉属 (*Glomus* spp.), 蜡蘑属 (*Laccaria* spp.), 布氏乳杆菌 (*Lactobacillus buchneri*), 类球囊霉属 (*Paraglomus* spp.), *Pisolithus tinctorius*, 假单胞菌属 (*Pseudomonas* spp.), 根瘤菌属 (*Rhizobium* spp.), 尤其是三叶草根瘤菌 (*Rhizobium trifolii*), 须腹菌属 (*Rhizopogon* spp.), 硬皮马勃属 (*Scleroderma* spp.), 乳牛肝菌属 (*Suillus* spp.), 链霉菌属 (*Streptomyces* spp.)。

[0696] 用作或可用作生物农药的植物提取物和由微生物形成的产物 (包括蛋白质和次生

代谢物)的实例为:

[0697] 大蒜(*Allium sativum*)、苦艾(*Artemisia absinthium*)、印楝素(*azadirachtin*)、Biokeeper WP、*Cassia nigricans*、苦皮藤(*Celastrus angulatus*)、*Chenopodium anthelminticum*、几丁质、*Armour-Zen*、欧洲鳞毛蕨(*Dryopteris filix-mas*)、问荆(*Equisetum arvense*)、*Fortune Aza*、*Fungastop*、*Heads Up*(藜麦皂苷提取物(*Chenopodium quinoa saponin extract*))、除虫菊(*pyrethrum*)/除虫菊酯(*pyrethrins*)、苏里南苦木(*Quassia amara*)、栎(*Quercus*)、皂树(*Quillaja*)、*Regalia*、“*Requiem*TM杀昆虫剂”、鱼藤酮(*rotenone*)、鱼尼丁(*ryania*)/兰尼碱(*ryanodine*)、聚合草(*Symphytum officinale*)、菊蒿(*Tanacetum vulgare*)、百里酚(*thymol*)、*Triact 70*、*TriCon*、*Tropaeulum majus*、大荨麻(*Urtica dioica*)、藜芦碱(*Veratrin*)、白槲寄生(*Viscum album*)、十字花科(*Brassicaceae*)提取物(尤其是油菜粉或芥菜粉)。

[0698] 作为混合组分的安全剂

[0699] 式(I)的化合物可与安全剂结合,所述安全剂为例如解草啉(*benoxacor*)、解毒啉(*cloquintocet (-mexyl)*)、解草胺腈(*cyometrinil*)、环丙磺酰胺(*cyprosulfamide*)、二氯丙烯胺(*dichlormid*)、解草唑(*fenchlorazole (-ethyl)*)、解草啉(*fenclorim*)、解草胺(*flurazole*)、氟草肟(*fluxofenim*)、解草恶唑(*furilazole*)、双苯恶唑酸(*isoxadifen (-ethyl)*)、吡啶解草酯(*mefenpyr (-diethyl)*)、萘二甲酸酐(*naphthalic anhydride*)、解草腈(*oxabetrinil*)、2-甲氧基-N-({4-[(甲基氨基甲酰基) 氨基] 苯基} 磺酰基) 苯甲酰胺(CAS 129531-12-0)、4-(二氯乙酰基)-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷(CAS 71526-07-3)、2,2,5-三甲基-3-(二氯乙酰基)-1,3-噁唑烷(CAS 52836-31-4)。

[0700] 植物和植物部位

[0701] 可根据本发明处理所有的植物和植物部位。在本文中,植物应理解为意指所有的植物和植物种群,例如需要和不需要的野生植物或作物植物(包括天然存在的作物植物),例如谷类(小麦、稻、黑小麦、大麦、黑麦、燕麦)、玉米、大豆、马铃薯、甜菜、甘蔗、番茄、甜椒、黄瓜、甜瓜、胡萝卜、西瓜、洋葱、莴苣、菠菜、韭菜、菜豆、甘蓝(*Brassica oleracea*) (例如卷心菜)和其他植物种类、棉花、烟草、油菜以及结果植物(果实为苹果、梨、柑橘类果实和葡萄)。作物植物可为可通过常规育种和优化方法或通过生物技术和基因工程方法或这些方法的组合而获得的植物,包括转基因植物且包括可受植物育种者权利保护或不受育种者权利保护的植物栽培种。植物应理解为意指所有的发育阶段如种子、幼苗、幼小(未成熟的)植物直至并包括成熟植物。植物部位应理解为意指植物的所有地上和地下的部位和器官,例如芽、叶、花和根,给定的实例为叶、针叶、茎、干、花、子实体、果实和种子,以及根、块茎和根茎。植物部位还包括采收的植物或采收的植物部位以及无性繁殖和有性繁殖材料,例如插条、块茎、根茎、幼枝(*slip*)和种子。

[0702] 本发明的使用式(I)的化合物对植物和植物部位的处理通过常规处理方法直接进行或使所述化合物作用于其环境、生境或贮存空间来进行,所述常规处理方法为例如浸渍、喷雾、蒸发、弥雾(*fogging*)、散布(*scattering*)、涂抹、注射,并且对于繁殖材料、尤其是对于种子,还可通过施加一层或多层包衣来进行。

[0703] 如上所述,可根据本发明处理所有的植物及其部位。在一个优选的实施方案中,处理野生植物品种和植物栽培种或通过常规生物育种方法如杂交或原生质体融合而获得的

那些植物及其部位。在另一个优选的实施方案中,处理通过基因工程方法——如果合适与常规方法结合——获得的转基因植物和植物栽培种(遗传修饰生物体)及其部位。术语“部位”或“植物的部位”或“植物部位”已在上文进行了解释。根据本发明,特别优选处理相应市售的常规植物栽培种的植物或在使用中的那些植物。植物栽培种应理解为意指具有新特性(“性状”)且已通过常规育种、诱变或重组DNA技术获得的植物。它们可为栽培种、变种、生物型或基因型。

[0704] 转基因植物、种子处理和整合株系(integration event)

[0705] 待根据本发明处理的优选的转基因植物或植物栽培种(通过基因工程获得的那些植物)包括通过遗传修饰而接受了遗传物质的所有植物,所述遗传物质赋予这些植物特别有利的、有用的特性(“性状”)。此类特性的实例为更好的植物生长、提高的对高温或低温的耐受性、提高的对干旱或者对水或土壤盐渍度水平的耐受性、增强的开花性能、更容易的采收、加速的成熟、更高的采收量、采收产品的更高的质量和/或更高的营养价值、采收产品的更好的保存能力和/或加工性能。这类特性的其他且特别强调的实例为:由于例如在植物内形成的毒素、特别是通过来自苏云金芽孢杆菌的遗传物质(例如通过基因CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb和CryIF及其组合)在植物内形成的那些毒素而使植物对动物类有害物和微生物类有害物如昆虫、蛛形纲动物、线虫、螨、蛞蝓和蜗牛的抗性增强,以及由例如系统获得性抗性(SAR)、系统素、植物抗毒素、诱导子(elicitor)和抗性基因以及相应表达的蛋白质和毒素引起植物对植物病原性真菌、细菌和/或病毒的抗性增强,以及植物对某些除草活性化合物例如咪唑啉酮类、磺酰脲类、草甘膦或草丁膦(phosphinothricin)的耐受性提高(例如“PTA”基因)。赋予所述期望特性(“性状”)的基因也可彼此结合存在于转基因植物中。提及的转基因植物的实例包括重要的作物植物,例如谷类(小麦、稻、黑小麦、大麦、黑麦、燕麦)、玉米、大豆、马铃薯、甜菜、甘蔗、番茄、豌豆和其他蔬菜品种、棉花、烟草、油菜以及结果植物(果实为苹果、梨、柑橘类果实和葡萄),特别强调玉米、大豆、小麦、稻、马铃薯、棉花、甘蔗、烟草和油菜。特别强调的特性(“性状”)为植物对昆虫、蛛形纲动物、线虫以及蛞蝓和蜗牛的抗性增强。

[0706] 作物保护——处理的类型

[0707] 使用常规处理方法用式(I)的化合物对植物和植物部位进行直接处理,或通过作用于其环境、生境或贮存空间进行处理,所述常规处理方法例如浸渍、喷雾、雾化、灌溉、蒸发、撒粉、弥雾、撒播、发泡、涂布、铺展(spreading-on)、注射、浇水(浸透)、滴灌,并且对于繁殖材料、特别是对于种子,还通过干种子处理、液体种子处理、浆料处理,通过形成包壳(incrusting),通过用一层或多层包衣包覆等。还可通过超低容量法施用式(I)的化合物或可将施用形式或式(I)的化合物本身注入到土壤中。

[0708] 优选的对植物的直接处理为叶面施用,意指将式(I)的化合物施用于叶子,在这种情况下,应根据所述有害物的侵染水平来调节处理频率和施用率。

[0709] 对于系统性活性化合物,式(I)的化合物也可通过根系进入植物。然后通过将式(I)的化合物作用于植物的生境来处理植物。这可例如通过以下方式来完成:浸透,或混入土壤或营养液中,意指用液体形式的式(I)的化合物浸渍植物的位置(例如土壤或水培体系),或土壤施用,意指将本发明的式(I)的化合物以固体形式(例如以颗粒剂的形式)引入植物的位置。对于水稻作物,这也可通过将固体施用形式(例如以颗粒剂的形式)的式(I)的

化合物计量加入淹没的稻田中来完成。

[0710] 种子处理

[0711] 通过对植物的种子进行处理而防治动物类有害物是早就已知的,并且是不断改进的主题。然而,对种子的处理产生了一系列始终不能以令人满意的方式来解决的问题。因此,期望开发保护种子和发芽植物的方法,所述方法在贮存期间、在播种后或在植物出苗后无需或至少显著降低额外的农药施用。此外,期望优化使用的活性化合物的量,从而为种子和发芽植物提供最佳保护,使其免受动物类有害物侵袭,而使用的活性化合物不会损害植物本身。特别地,用于种子处理的方法还应考虑抵抗或耐受有害物的转基因植物所固有的杀昆虫特性或杀线虫特性,以使用最少量的农药实现对种子以及发芽植物的最佳保护。

[0712] 因此,本发明还特别涉及一种通过用式(I)的化合物之一处理种子来保护种子和发芽植物免受有害物侵袭的方法。本发明的保护种子和发芽植物免受有害物侵袭的方法还包括这样的方法,其中用式(I)的化合物和混合组分在一次操作中同时对种子进行处理或依序对种子进行处理。其另外还包括这样的方法,其中用式(I)的化合物和混合组分在不同的时间对种子进行处理。

[0713] 本发明还涉及式(I)的化合物用于处理种子以保护种子和所得植物免受动物类有害物侵袭的用途。

[0714] 本发明还涉及已用本发明的式(I)的化合物进行处理以保护其免受动物类有害物侵袭的种子。本发明还涉及已用式(I)的化合物和混合组分同时处理的种子。本发明还涉及已用式(I)的化合物和混合组分在不同时间进行处理的种子。对于已用式(I)的化合物和混合组分在不同时间进行处理的种子,各物质可以不同的层存在于种子上。在这种情况下,包含式(I)的化合物和混合组分的层可任选地通过中间层隔开。本发明还涉及这样的种子:其中将式(I)的化合物和混合组分作为包衣的一部分或作为除包衣之外的另一层或另几层进行施用。

[0715] 本发明还涉及这样的种子:在用式(I)的化合物进行处理后,对其进行薄膜包衣处理以避免种子受灰尘磨损。

[0716] 在式(I)的化合物系统性起作用时,出现的优点之一在于对种子进行处理不仅保护种子本身,还保护由其产生的植物在出苗后免受动物类有害物的侵袭。以这种方式,可免除在播种时或播种后不久对作物进行即时处理。

[0717] 另一个优点在于,用式(I)的化合物对种子进行处理可增强被处理的种子的发芽和出苗。

[0718] 同样认为有利的是,式(I)的化合物还可特别地用于转基因种子。

[0719] 式(I)的化合物还可与信号技术组合物结合使用,从而使得通过共生体(例如根瘤菌、菌根和/或植物内生细菌或真菌)而更好地定殖和/或优化固氮作用。

[0720] 式(I)的化合物适于保护在农业、温室、林业或园艺中使用的任何植物品种的种子。更具体而言,所述种子为谷类(例如小麦、大麦、黑麦、粟和燕麦)、玉米、棉花、大豆、稻、马铃薯、向日葵、咖啡、烟草、加拿大油菜(canola)、油菜、甜菜(例如糖用甜菜和饲用甜菜)、花生、蔬菜类(例如番茄、黄瓜、菜豆、十字花科蔬菜、洋葱和莴苣)、结果植物、草坪植物和观赏植物的种子。特别有意义的是处理谷类(例如小麦、大麦、黑麦和燕麦)、玉米、大豆、棉花、加拿大油菜、油菜、蔬菜类和稻的种子。

[0721] 如上所述,用式(I)的化合物对转基因种子进行处理也是特别重要的。这涉及通常含有至少一种异源基因的植物的种子,所述异源基因控制特别是具有杀昆虫和/或杀线虫特性的多肽的表达。转基因种子中的异源基因可源于微生物如芽孢杆菌属(*Bacillus*)、根瘤菌属(*Rhizobium*)、假单胞菌属(*Pseudomonas*)、沙雷氏菌属(*Serratia*)、木霉属(*Trichoderma*)、棒形杆菌属(*Clavibacter*)、球囊霉属(*Glomus*)或粘帚霉属(*Gliocladium*)。本发明特别适于处理包含至少一种源于芽孢杆菌属的异源基因的转基因种子。所述异源基因更优选源于苏云金芽孢杆菌。

[0722] 在本发明的上下文中,将式(I)的化合物施用于种子。优选地,在种子足够稳定以在处理过程中不发生损害的状态下处理种子。通常,可在采收和播种之间的任意时间处理种子。通常使用已从植物中分离出来并且已经除去穗轴、外壳、茎、表皮、绒毛或果肉的种子。例如,可使用已经采收、清洁并且干燥至允许存储的含水量的种子。或者,也可使用干燥后已用例如水进行处理然后再干燥(例如灌注(priming))的种子。对于稻的种子,也可使用已在例如水中浸泡直至其到达稻胚(“胚乳期(pigeon breast stage)”)的某一阶段的种子,这可刺激发芽并使出苗更均匀。

[0723] 当处理种子时,通常必须注意选择施用于种子的式(I)的化合物的量和/或其他添加剂的量,使得种子的发芽不受到不利影响,或所得植物不受到损害。对于在某些施用率下可以表现出植物毒性作用的活性化合物,必须特别确保这一点。

[0724] 通常,将式(I)的化合物以合适的制剂形式施用于种子。用于种子处理的合适的制剂和方法是本领域技术人员已知的。

[0725] 可将式(I)的化合物转化为常规拌种制剂,例如溶液剂、乳剂、悬浮剂、粉剂、泡沫剂、浆剂或其他种子包衣组合物,以及ULV制剂。

[0726] 这些制剂用已知方式通过将式(I)的化合物与常规添加剂混合而制备,所述常规添加剂为例如常规增量剂和溶剂或稀释剂、染料、润湿剂、分散剂、乳化剂、消泡剂、防腐剂、二次增稠剂、胶粘剂、赤霉素以及水。

[0727] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的合适的染料为通常用于此类目的的所有染料。可使用微溶于水的颜料或溶于水的染料。实例包括已知的名称为罗丹明B、C.I. 颜料红112和C.I. 溶剂红1的染料。

[0728] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的有用的润湿组合物为促进润湿并且通常用于农业化学活性化合物的制剂的所有物质。优选可使用萘磺酸烷基酯,例如萘磺酸二异丙酯或萘磺酸二异丁酯。

[0729] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的合适的分散剂和/或乳化剂为通常用于农业化学活性化合物的制剂的所有非离子、阴离子和阳离子分散剂。优选可使用非离子或阴离子分散剂或非离子或阴离子分散剂的混合物。合适的非离子分散剂尤其包括环氧乙烷/环氧丙烷嵌段聚合物、烷基酚聚乙二醇醚和三苯乙基酚聚乙二醇醚,及其磷酸化或硫酸化衍生物。合适的阴离子分散剂尤其为木素磺酸盐、聚丙烯酸盐和芳基磺酸酯-甲醛缩合物。

[0730] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的消泡剂为通常用于农业化学活性化合物的制剂的所有抑制泡沫的物质。可优选使用有机硅(silicone)消泡剂和硬脂酸镁。

[0731] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的防腐剂为可在农业化学组合物中用

于此类目的的所有物质。实例包括双氯酚和苄醇半缩甲醛。

[0732] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的有用的二次增稠剂为可在农业化学组合中用于此类目的的所有物质。优选的实例包括纤维素衍生物、丙烯酸衍生物、黄原胶、改性粘土以及细碎的二氧化硅。

[0733] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的有用的粘着剂为可用于拌种产品中的所有常规粘合剂。优选的实例包括聚乙烯吡咯烷酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇和甲基纤维素(tylose)。

[0734] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的有用的赤霉素优选为赤霉素A1、A3(=赤霉酸)、A4和A7;特别优选使用赤霉酸。赤霉素是已知的(参见R.Wegler“Chemie der Pflanzenschutz-und **Schädlingsbekämpfungsmittel**”,第2卷,Springer Verlag,1970,第401-412页)。

[0735] 可根据本发明使用的拌种制剂可直接或预先用水稀释后用于处理多种不同种类的种子。例如,浓缩剂或可通过用水稀释而由其获得的制剂可用于对以下种子进行拌种:谷类(如小麦、大麦、黑麦、燕麦和黑小麦)的种子以及玉米、稻、油菜、豌豆、菜豆、棉花、向日葵、大豆和甜菜的种子,或多种不同的蔬菜种子。可根据本发明使用的拌种制剂或其稀释的施用形式还可用于对转基因植物的种子进行拌种。

[0736] 对于用可根据本发明使用的拌种制剂或通过加水而由其制得的施用形式处理种子而言,通常可用于拌种的所有混合单元都是有用的。具体而言,拌种的过程为:以分批或连续操作的方式将种子置入混合器中,加入特定所需量的拌种制剂(以其本身或预先用水稀释后),以及进行混合直至制剂均匀地分布在种子上。如果合适,随后进行干燥操作。

[0737] 可根据本发明使用的拌种制剂的施用率可在相对宽的范围内变化。这取决于制剂中式(I)的化合物的具体含量以及种子。式(I)的化合物的施用率通常为每千克种子0.001至50g,优选为每千克种子0.01至15g。

[0738] 动物健康

[0739] 在动物健康领域,即兽医学领域,式(I)的化合物对动物寄生虫、特别是体外寄生虫或体内寄生虫具有活性。术语“体内寄生虫”尤其包括蠕虫和原生动物,例如球虫(coccidia)。体外寄生虫通常且优选为节肢动物,尤其是昆虫或螨类。

[0740] 在兽医学领域,具有有利的恒温动物毒性的式(I)的化合物适于防治在家畜、育种动物、动物园动物、实验室动物、实验动物和家养动物的动物育种和动物饲养中出现的寄生虫。它们对所述寄生虫的所有或特定发育阶段均具有活性。

[0741] 农业家畜包括例如哺乳动物,例如绵羊、山羊、马、驴、骆驼、水牛、兔、驯鹿、扁角鹿,以及尤其是牛和猪;或家禽如火鸡、鸭、鹅,以及尤其是鸡;或例如水产养殖中的鱼或甲壳类动物;或——根据具体情况——昆虫如蜜蜂。

[0742] 家养动物包括例如哺乳动物,例如仓鼠、豚鼠、大鼠、小鼠、毛丝鼠、雪貂,以及特别是狗、猫、笼养鸟;爬行动物、两栖动物或观赏鱼。

[0743] 在一个具体实施方案中,将式(I)的化合物给予哺乳动物。

[0744] 在另一个具体实施方案中,将式(I)的化合物给予鸟类,即笼养鸟或特别是家禽。

[0745] 使用式(I)的化合物来防治动物寄生虫旨在减少或预防疾病、死亡案例和性能降低(对于肉、奶、羊毛、皮、蛋、蜂蜜等),使得动物饲养更经济和更简单并可实现更好的动物

健康。

[0746] 关于动物健康领域,在本上下文中,术语“防治(control)”或“防治(controlling)”意指式(I)的化合物可有效将特定寄生虫在感染此类寄生虫的动物中的发病率降低至无害的程度。更具体而言,在本上下文中,“防治”意指式(I)的化合物杀死各寄生虫、抑制其生长或抑制其繁殖。

[0747] 节肢动物包括但不限于,例如,

[0748] 来自虱目(Anoplurida)的节肢动物,例如血虱属(Haematopinus spp.)、毛虱属(Linognathus spp.)、虱属(Pediculus spp.)、阴虱属(Phtirus spp.)和管虱属(Solenopotes spp.);

[0749] 来自食毛目(Mallophagida)和钝角亚目(Amblycerina)以及细角亚目(Ischnocerina)的节肢动物,例如牛羽虱属(Bovicola spp.)、Damalina spp.、猫羽虱属(Felicola spp.);Lepikentron spp.、禽虱属(Menopon spp.)、啮毛虱属(Trichodectes spp.)、毛羽虱属(Trimenopon spp.)、巨羽虱属(Trinoton spp.)、Werneckiella spp.;

[0750] 来自双翅目(Diptera)和长角亚目(Nematocerina)以及短角亚目(Brachycerina)的节肢动物,例如伊蚊属(Aedes spp.)、按蚊属(Anopheles spp.)、黄虻属(Atylotus spp.)、蜂虱蝇属(Braula spp.)、丽蝇属(Calliphora spp.)、金蝇属(Chrysomyia spp.)、斑虻属(Chrysops spp.)、库蚊属(Culex spp.)、库蠓属(Culicoides spp.)、真蚋属(Eusimulium spp.)、厕蝇属(Fannia spp.)、胃蝇属(Gasterophilus spp.)、舌蝇属(Glossina spp.)、角蝇属(Haematobia spp.)、麻虻属(Haematopota spp.)、虱蝇属(Hippobosca spp.)、瘤虻属(Hybomitra spp.)、齿股蝇属(Hydrotaea spp.)、皮蝇属(Hypoderma spp.)、羊虱蝇属(Lipoptena spp.)、绿蝇属(Lucilia spp.)、罗蛉属(Lutzomyia spp.)、蜉蝇属(Melophagus spp.)、莫蝇属(Morellia spp.)、家蝇属(Musca spp.)、短蚋亚属(Odagmia spp.)、狂蝇属(Oestrus spp.)、Philipomyia spp.、白蛉属(Phlebotomus spp.)、鼻狂蝇属(Rhinoestrus spp.)、麻蝇属(Sarcophaga spp.)、蚋属(Simulium spp.)、螫蝇属(Stomoxys spp.)、虻属(Tabanus spp.)、大蚊属(Tipula spp.)、维蚋属(Wilhelmia spp.)、污蝇属(Wohlfahrtia spp.);

[0751] 来自蚤目(Siphonapterida)的节肢动物,例如角叶蚤属(Ceratophyllus spp.)、栉首蚤属(Ctenocephalides spp.)、蚤属(Pulex spp.)、潜蚤属(Tunga spp.)、客蚤属(Xenopsylla spp.);

[0752] 来自异翅目(Heteropterida)的节肢动物,例如臭虫属(Cimex spp.)、锥蝽属(Panstrongylus spp.)、红猎蝽属(Rhodnius spp.)、锥猎蝽属(Triatoma spp.);以及来自蜚蠊目(Blattarida)的讨厌的有害物和卫生有害物。

[0753] 此外,对于节肢动物,作为举例而非限制,应当提及下列蜱螨亚纲(Acari):

[0754] 来自蜱螨亚纲(蜱螨目(Acarina)和后气门目(Metastigmata)的节肢动物,例如隐喙蜱科(Argasidae),例如锐缘蜱属(Argas spp.)、钝缘蜱属(Ornithodoros spp.)、残缘蜱属(Otobius spp.)、硬蜱科(Ixodidae),例如花蜱属(Amblyomma spp.)、革蜱属(Dermacentor spp.)、血蜱属(Haemaphysalis spp.)、璃眼蜱属(Hyalomma spp.)、硬蜱属(Ixodes spp.)、扇头蜱属(牛蜱属)(Rhipicephalus(Boophilus) spp.)、扇头蜱属(Rhipicephalus spp.) (多宿主蜱的原属);来自中气门目(Mesostigmata)的节肢动物,例

如皮刺螨属 (*Dermanyssus* spp.)、禽刺螨属 (*Ornithonyssus* spp.)、肺刺螨属 (*Pneumonyssus* spp.)、刺利螨属 (*Raillietia* spp.)、胸刺螨属 (*Sternostoma* spp.)、热厉螨属 (*Tropilaelaps* spp.)、瓦螨属 (*Varroa* spp.); 来自辐螨目 (*Actinedida*) (前气门目 (*Prostigmata*)) 的节肢动物, 例如蜂盾螨属 (*Acarapis* spp.)、姬螯螨属 (*Cheyletiella* spp.)、蠕形螨属 (*Demodex* spp.)、*Listrophorus* spp.、肉螨属 (*Myobia* spp.)、新恙螨属 (*Neotrombicula* spp.)、禽螯螨属 (*Ornithocheyletia* spp.)、疮螨属 (*Psorergates* spp.)、恙螨属 (*Trombicula* spp.); 和来自粉螨目 (*Acaridida*) (无气门目 (*Astigmata*)) 的节肢动物, 例如粉螨属 (*Acarus* spp.)、嗜木螨属 (*Caloglyphus* spp.)、足螨属 (*Chorioptes* spp.)、胞螨属 (*Cytodites* spp.)、颈下螨属 (*Hypodectes* spp.)、疔螨属 (*Knemidocoptes* spp.)、鸡雏螨属 (*Laminosioptes* spp.)、背肛螨属 (*Notoedres* spp.)、耳螨属 (*Otodectes* spp.)、痒螨属 (*Psoroptes* spp.)、翅螨属 (*Pterolichus* spp.)、疥螨属 (*Sarcoptes* spp.)、*Trixacarus* spp.、食酪螨属 (*Tyrophagus* spp.)。

[0755] 寄生原生动物的实例包括, 但不限于:

[0756] 鞭毛纲 (*Mastigophora*) (鞭毛虫纲 (*Flagellata*)), 例如:

[0757] 后滴门 (*Metamonada*): 双滴虫目 (*Diplomonadida*), 例如贾第虫属 (*Giardia* spp.)、旋核鞭毛虫属 (*Spironucleus* spp.)。

[0758] 副基体纲 (*Parabasala*): 毛滴虫目 (*Trichomonadida*), 例如组织滴虫属 (*Histomonas* spp.)、五毛滴虫属 (*Pentatrichomonas* spp.)、四毛滴虫属 (*Tetratrichomonas* spp.)、毛滴虫属 (*Trichomonas* spp.)、三毛滴虫属 (*Tritrichomonas* spp.)。

[0759] 眼虫门 (*Euglenozoa*): 锥体虫目 (*Trypanosomatida*), 例如利什曼原虫属 (*Leishmania* spp.)、锥体虫属 (*Trypanosoma* spp.)。

[0760] 肉足鞭毛亚门 (*Sarcomastigophora*) (根足亚纲 (*Rhizopoda*)) 如内阿米巴科 (*Entamoebidae*), 例如内变形虫属 (*Entamoeba* spp.), *Centramoebidae*, 例如棘阿米巴属 (*Acanthamoeba* sp.), *Euamoebidae*, 例如哈氏虫属 (*Hartmanella* sp.)。

[0761] 囊泡虫类 (*Alveolata*) 如顶复亚门 (*Apicomplexa*) (孢子虫类 (*Sporozoa*)): 例如隐孢子虫属 (*Cryptosporidium* spp.); 艾美目 (*Eimeriida*), 例如贝诺孢子虫属 (*Besnoitia* spp.)、囊等孢球虫属 (*Cystoisospora* spp.)、艾美球虫属 (*Eimeria* spp.)、哈蒙属 (*Hammondia* spp.)、等孢子球虫属 (*Isospora* spp.)、新孢子虫属 (*Neospora* spp.)、肉孢子虫属 (*Sarcocystis* spp.)、弓形虫属 (*Toxoplasma* spp.); *Adeleida*, 例如肝簇虫属 (*Hepatozoon* spp.)、克洛西埃拉属 (*Klossiella* spp.); 血孢子虫目 (*Haemosporida*), 例如住白虫属 (*Leucocytozoon* spp.)、疟原虫属 (*Plasmodium* spp.); 梨形虫目 (*Piroplasmida*), 例如巴倍虫属 (*Babesia* spp.)、纤毛虫属 (*Ciliophora* spp.)、*Echinozoon* spp.、泰勒虫属 (*Theileria* spp.); *Vesibuliferida*, 例如肠袋虫属 (*Balantidium* spp.)、*Buxtonella* spp.。

[0762] 微孢子门 (*Microspora*) 如脑胞内原虫属 (*Encephalitozoon* spp.)、肠孢子虫属 (*Enterocytozoon* spp.)、球虫属 (*Globidium* spp.)、小孢子虫属 (*Nosema* spp.), 以及例如 *Myxozoa* spp.。

[0763] 对人类或动物致病的蠕虫包括, 例如棘头动物门 (*Acanthocephala*)、线虫类

(Nematoden)、舌形动物门(Pentastoma)和扁形动物门(Platyhelminthes)(例如单殖亚纲(Monogenea)、绦虫类(cestodes)和吸虫类(trematodes))。

[0764] 示例性蠕虫包括,但不限于:

[0765] 单殖亚纲(Monogenea):例如:指环虫属(Dactylogyrus spp.)、三代虫属(Gyrodactylus spp.)、Microbothrium spp.、多盘虫属(Polystoma spp.)、Trogglecephalus spp.;

[0766] 绦虫类:来自假叶目(Pseudophyllidea)的绦虫,例如:吸叶绦虫属(Bothridium spp.)、裂头绦虫属(Diphyllobothrium spp.)、大复殖孔绦虫属(Diplogonoporus spp.)、Ichthyobothrium spp.、舌状绦虫属(Ligula spp.)、裂头绦虫属(Schistocephalus spp.)、迭宫绦虫属(Spirometra spp.)。

[0767] 来自圆叶目(Cyclophyllida)的绦虫,例如:Andyra spp.、裸头绦虫属(Anoplocephala spp.)、无卵黄腺属(Avitellina spp.)、伯特绦虫属(Bertiella spp.)、鸣绦虫属(Cittotaenia spp.)、戴文氏绦虫属(Davainea spp.)、双睾绦虫属(Diorchis spp.)、Diplopylidium spp.、复孔绦虫属(Dipylidium spp.)、棘球属(Echinococcus spp.)、Echinocotyle spp.、棘鳞绦虫属(Echinolepis spp.)、泡尾绦虫属(Hydatigera spp.)、膜壳绦虫属(Hymenolepis spp.)、乔伊属(Joyeuxiella spp.)、中殖孔绦虫属(Mesocestoides spp.)、莫尼茨绦虫属(Moniezia spp.)、副裸头属(Paranoplocephala spp.)、瑞列绦虫属(Raillietina spp.)、斯泰勒绦虫属(Stilesia spp.)、带绦虫属(Taenia spp.)、曲子宫绦虫属(Thysaniezia spp.)、遂体绦虫属(Thysanosoma spp.)。

[0768] 吸虫类:来自复殖纲(Digenea)的吸虫,例如:澳毕吸虫属(Austrobilharzia spp.)、短咽属(Brachylaima spp.)、杯殖属(Calicophoron spp.)、下弯属(Catatropis spp.)、支睾属(Clonorchis spp.)、肛瘤吸虫属(Collyriclum spp.)、殖盘属(Cotylophoron spp.)、环腔属(Cyclocoelum spp.)、双腔属(Dicrocoelium spp.)、双穴吸虫属(Diplostomum spp.)、棘隙属(Echinochasmus spp.)、棘缘属(Echinoparyphium spp.)、棘口属(Echinostoma spp.)、阔盘属(Eurytrema spp.)、片吸虫属(Fasciola spp.)、Fasciolides spp.、姜片虫属(Fasciolopsis spp.)、菲策属(Fischoederius spp.)、腹袋吸虫属(Gastrothylacus spp.)、巨毕吸虫属(Gigantobilharzia spp.)、巨盘属(Gigantocotyle spp.)、异形吸虫属(Heterophyes spp.)、低颈属(Hypoderaeum spp.)、彩蚴吸虫属(Leucochloridium spp.)、后殖吸虫属(Metagonimus spp.)、次睾属(Metorchis spp.)、侏形吸虫属(Nanophyetus spp.)、背孔属(Notocotylus spp.)、后睾吸虫属(Opisthorchis spp.)、东毕血吸虫属(Ornithobilharzia spp.)、并殖吸虫属(Paragonimus spp.)、同盘属(Paramphistomum spp.)、斜睾吸虫属(Plagiorchis spp.)、茎双穴吸虫属(Posthodiplostomum spp.)、前殖属(Prosthogonimus spp.)、血吸虫属(Schistosoma spp.)、毛血吸虫属(Trichobilharzia spp.)、隐孔吸虫属(Trogloctrema spp.)、盲腔属(Typhlocoelum spp.)。

[0769] 线虫类:来自毛形目(Trichinellida)的线虫,例如:毛细线虫属(Capillaria spp.)、毛线虫属(Trichinella spp.)、Trichomosoides spp.、鞭虫属(Trichuris spp.)。

[0770] 来自垫刃目(Tylenchida)的线虫,例如:细丝鲶属(Micronema spp.)、Parastrangyloides spp.、类圆线虫属(Strongyloides spp.)。

[0771] 来自杆形目 (Rhabditina) 的线虫, 例如: 猫圆线虫属 (*Aelurostrongylus* spp.)、裂口线虫属 (*Amidostomum* spp.)、钩虫属 (*Ancylostoma* spp.)、管圆线虫属 (*Angiostrongylus* spp.)、*Bronchonema* spp.、仰口线虫属 (*Bunostomum* spp.)、夏柏特线虫属 (*Chabertia* spp.)、古柏线虫属 (*Cooperia* spp.)、*Cooperioides* spp.、环体线虫属 (*Crenosoma* spp.)、盅口属 (*Cyathostomum* spp.)、*Cyclococercus* spp.、*Cyclodontostomum* spp.、杯环属 (*Cylicocyclus* spp.)、杯冠属 (*Cylicostephanus* spp.)、柱咽属 (*Cylindropharynx* spp.)、囊尾线虫属 (*Cystocaulus* spp.)、网尾线虫属 (*Dictyocaulus* spp.)、鹿圆线虫属 (*Elaphostrongylus* spp.)、类丝虫属 (*Filaroides* spp.)、球首属 (*Globocephalus* spp.)、*Graphidium* spp.、辐首属 (*Gyaloccephalus* spp.)、血矛线虫属 (*Haemonchus* spp.)、*Heligmosomoides* spp.、猪圆属 (*Hyostongylus* spp.)、马歇尔属 (*Marshallagia* spp.)、后圆线虫属 (*Metastrongylus* spp.)、缪勒线虫属 (*Muellerius* spp.)、板口线虫属 (*Necator* spp.)、细颈线虫属 (*Nematodirus* spp.)、新圆线虫属 (*Neostongylus* spp.)、日圆线虫属 (*Nippostrongylus* spp.)、尖柱属 (*Obeliscoides* spp.)、食道齿属 (*Oesophagodontus* spp.)、结节线虫属 (*Oesophagostomum* spp.)、盘头线虫属 (*Ollulanus* spp.)；鸟圆属 (*Ornithostrongylus* spp.)、奥斯勒属 (*Oslerus* spp.)、胃线虫属 (*Ostertagia* spp.)、副古柏线虫属 (*Paracooperia* spp.)、*Paracrenosoma* spp.、类副丝虫属 (*Parafilaroides* spp.)、副鹿圆线虫属 (*Parelaphostrongylus* spp.)、*Pneumocaulus* spp.、肺圆线虫属 (*Pneumostongylus* spp.)、孟口属 (*Poteriostomum* spp.)、原圆线虫属 (*Protostrongylus* spp.)、锐尾线虫属 (*Spicocaulus* spp.)、冠尾属 (*Stephanurus* spp.)、圆线虫属 (*Strongylus* spp.)、比翼属 (*Syngamus* spp.)、背带线虫属 (*Teladorsagia* spp.)、毛线属 (*Trichonema* spp.)、毛圆线虫属 (*Trichostrongylus* spp.)、三齿属 (*Triodontophorus* spp.)、*Troglostongylus* spp.、钩虫属 (*Uncinaria* spp.)。

[0772] 来自旋尾目 (Spirurida) 的线虫, 例如: 棘唇线虫属 (*Acanthocheilonema* spp.)、异尖属 (*Anisakis* spp.)、鸡蛔虫属 (*Ascaridia* spp.)；蛔虫属 (*Ascaris* spp.)、似蛔属 (*Ascarops* spp.)、无刺属 (*Aspiculuris* spp.)、贝蛔属 (*Baylisascaris* spp.)、布鲁线虫属 (*Brugia* spp.)、*Cercopithifilaria* spp.、*Crassicauda* spp.、双瓣线虫属 (*Dipetalonema* spp.)、恶丝虫属 (*Dirofilaria* spp.)、龙线虫属 (*Dracunculus* spp.)；*Draschia* spp.、蛲虫属 (*Enterobius* spp.)、丝虫属 (*Filaria* spp.)、颞口线虫属 (*Gnathostoma* spp.)、筒线虫属 (*Gongylonema* spp.)、丽线虫属 (*Habronema* spp.)、异刺线虫属 (*Heterakis* spp.)；类平滑丝虫属 (*Litomosoides* spp.)、罗阿丝虫属 (*Loa* spp.)、盘尾丝虫属 (*Onchocerca* spp.)、尖尾线虫属 (*Oxyuris* spp.)、副柔线虫属 (*Parabronema* spp.)、副丝虫属 (*Parafilaria* spp.)、副蛔虫属 (*Parascaris* spp.)、栓尾线虫属 (*Passalurus* spp.)、泡翼属 (*Physaloptera* spp.)、*Probstmayria* spp.、*Pseudofilaria* spp.、腹腔丝虫属 (*Setaria* spp.)、*Skjrabinema* spp.、旋尾线虫属 (*Spirocerca* spp.)、冠丝虫属 (*Stephanofilaria* spp.)、*Strongyluris* spp.、管状线虫属 (*Syphacia* spp.)、吸吮线虫属 (*Thelazia* spp.)、弓蛔线虫属 (*Toxascaris* spp.)、弓蛔虫属 (*Toxocara* spp.)、吴策线虫属 (*Wuchereria* spp.)。

[0773] 棘头动物门 (Acanthocephala)：少棘目 (Oligacanthorhynchida)，例如：巨吻棘头

虫属 (*Macracanthorhynchus* spp.)、前睾属 (*Prosthenorchis* spp.)；念珠目 (*Moniliformida*)，例如：念珠棘虫属 (*Moniliformis* spp.)。

[0774] 多形目 (*Polymorphida*)，例如：细颈属 (*Filicollis* spp.)；棘吻目 (*Echinorhynchida*)，例如棘头花属 (*Acanthocephalus* spp.)、棘吻虫属 (*Echinorhynchus* spp.)、似细吻棘头虫属 (*Leptorhynchoides* spp.)。

[0775] 舌形动物门：蛇舌状虫目 (*Porocephalida*)，例如，舌形虫属 (*Linguatula* spp.)。

[0776] 在兽医领域中和动物饲养中，通过本领域通常已知的方法如经肠内、肠外、真皮或鼻途径以合适的制剂形式给予式 (I) 的化合物。给予可为预防性的、后期预防性的 (*metaphylactic*) 或治疗性的。

[0777] 因此，本发明的一个实施方案涉及式 (I) 的化合物用作药物。

[0778] 另一个方面涉及式 (I) 的化合物用作抗体内寄生虫剂 (*antiendoparasitic agent*)。

[0779] 本发明的另一个具体方面涉及式 (I) 的化合物用作抗蠕虫剂 (*antithelminthic agent*)，特别是用作杀线虫剂、杀扁形动物剂 (*platyhelminthicide*)、杀棘头虫剂 (*acanthocephalicide*) 或杀舌形动物剂 (*pentastomicide*)。

[0780] 本发明的另一个具体方面涉及式 (I) 的化合物用作抗原生动物剂 (*antiprotozoic agent*)。

[0781] 另一个方面涉及式 (I) 的化合物用作抗体外寄生虫剂 (*antiectoparasitic agent*)，尤其是杀节肢动物剂 (*arthropodicide*)，非常特别是杀昆虫剂或杀螨剂。

[0782] 本发明的其他方面为兽医制剂，其包含有效量的至少一种式 (I) 的化合物和至少一种下列物质：药学上可接受的赋形剂 (例如固体或液体稀释剂)、药学上可接受的助剂 (例如表面活性剂)，尤其是通常在兽医制剂中使用的药学上可接受的赋形剂和/或通常在兽医制剂中使用的药学上可接受的助剂。

[0783] 本发明的一个相关方面为一种制备如本文中所述的兽医制剂的方法，其包括以下步骤：将至少一种式 (I) 的化合物与药学上可接受的赋形剂和助剂、尤其是与通常在兽医制剂中使用的药学上可接受的赋形剂和/或通常在兽医制剂中使用的助剂混合。

[0784] 本发明的另一个具体方面为兽医制剂及其制备方法，所述兽医制剂选自所述方面的杀体外寄生虫制剂和杀外内寄生虫制剂，尤其选自抗蠕虫制剂、抗原生动物制剂和杀节肢动物制剂，非常特别选自杀线虫制剂、杀扁形动物 (*platyhelminthidal*) 制剂、杀棘头虫 (*acanthocephalidicidal*) 制剂、杀舌形动物 (*pentastomicidal*) 制剂、杀昆虫制剂和杀螨制剂。

[0785] 另一个方面涉及一种通过在有此需要的动物、尤其是非人类动物中使用有效量的式 (I) 的化合物来治疗寄生感染、尤其是由选自本文中提及的体外寄生虫和体内寄生虫的寄生虫引起的感染的方法。

[0786] 另一个方面涉及一种通过在有此需要的动物、尤其是非人类动物中使用如本文中定义的兽医制剂来治疗寄生感染、尤其是由选自本文中提及的体外寄生虫和体内寄生虫的寄生虫引起的感染的方法。

[0787] 另一个方面涉及式 (I) 的化合物在动物、尤其是非人类动物中治疗寄生虫感染、尤其是由选自本文中提及的体外寄生虫和体内寄生虫的寄生虫引起的感染的用途。

[0788] 在动物健康或兽医学的上下文中,术语“治疗”指预防性的、后期预防性的和治疗性的治疗。

[0789] 在一个具体实施方案中,用这种方法为兽医学领域提供至少一种式(I)的化合物与其他活性化合物、尤其是与杀体内寄生虫剂和杀体外寄生虫剂的混合物。

[0790] 在动物健康领域,“混合物”不仅意指将两种(或更多种)不同的活性化合物配制在共同的制剂中并相应地一起使用,而且还涉及包含各活性化合物分开的制剂的产品。因此,当使用多于两种活性化合物时,所有的活性化合物可配制在共同的制剂中或所有的活性化合物可配制在分开的制剂中;同样可能的为这样的混合形式:其中一些活性化合物一起配制而一些活性化合物分开配制。分开的制剂使得所述活性化合物可以分开施用或连续施用。

[0791] 本文中以其“通用名称”说明的活性化合物是已知的并且记载于例如“Pesticide Manual”(参见上文)中或者可在因特网(例如:<http://www.alanwood.net/pesticides>)上检索。

[0792] 选自作为混合组分的杀体外寄生虫剂的示例性活性化合物——在没有任何应构成限制的意图的情况下——包括上文详细列出的杀昆虫剂和杀螨剂。根据上述基于当前IRAC作用方式分类方案的分类,下文列出可使用的其他活性化合物:(1)乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂;(2)GABA门控氯化物通道阻断剂;(3)钠通道调节剂;(4)烟碱能乙酰胆碱受体(nAChR)竞争调节剂;(5)烟碱能乙酰胆碱受体(nAChR)变构调节剂;(6)谷氨酸酯门控氯化物通道(GluCl)变构调节剂;(7)保幼激素模拟物;(8)多种非特异性(多位点)抑制剂;(9)弦音器官调节剂;(10)螨生长抑制剂;(12)线粒体ATP合酶抑制剂,例如ATP干扰剂;(13)通过间断质子梯度作用的氧化磷酸化解偶联剂;(14)烟碱能乙酰胆碱受体通道阻断剂;(15)0型几丁质生物合成抑制剂;(16)1型几丁质生物合成抑制剂;(17)蜕皮干扰剂(尤其是在双翅目中);(18)蜕皮激素受体激动剂;(19)章鱼胺受体激动剂;(21)线粒体复合物I电子传递抑制剂;(25)线粒体复合物II电子传递抑制剂;(20)线粒体复合物III电子传递抑制剂;(22)电压依赖型钠通道阻断剂;(23)乙酰基辅酶A(CoA)羧化酶抑制剂;(28)兰尼碱受体调节剂;

[0793] 具有未知或不确定的作用机理的活性化合物,例如氟硝二苯胺(fentrifanil)、氧嘧酰胺(fenoxacrim)、cycloprene、乙酯杀螨醇(chlorobenzilate)、杀虫脒(chlordimeform)、氟苯灭(flubenzimin)、环虫腈(dicyclanil)、磺胺螨酯(amidoflumet)、灭螨猛(quinomethionat)、苯螨噻(triarathene)、clothiazoben、杀螨好(tetrasul)、油酸钾、石油、恶虫酮(metoxadiazone)、gossyplur、氟螨嗪(flutenzine)、溴螨酯(brompropylate)、冰晶石;

[0794] 选自其他类的化合物,例如畜虫威(butacarb)、敌蝇威(dimetilan)、除线威(cloethocarb)、磷虫威(phosphocarb)、嘧啶磷(pirimiphos(-ethyl))、对硫磷(parathion(-ethyl))、虫螨畏(methacrifos)、o-水杨酸异丙酯、敌百虫(trichlorfon)、硫丙磷(sulprofos)、丙虫磷(propaphos)、克线丹(sebufos)、吡硫磷(pyridathion)、发硫磷(prothoate)、除线磷(dichlofenthion)、砒吸磷(demeton-S-methyl sulfone)、氯唑磷(isazofos)、苯腈磷(cyanofenphos)、氯亚磷(dialifos)、三硫磷(carbophenothion)、autathiofos、aromfenvinfos(-methyl)、谷硫磷(azinphos(-ethyl))、毒死蜱

(chlorpyrifos (-ethyl))、丁苯硫磷 (fosmethilan)、碘硫磷 (iodofenphos)、蔬果磷 (dioxabenzofos)、安果 (formothion)、地虫磷 (fonofos)、吡氟硫磷 (flupyrazofos)、丰索磷 (fensulfothion)、乙嘧硫磷 (etrimfos)；

[0795] 有机氯化物,例如毒杀芬 (camphechlor)、林丹 (lindane)、七氯 (heptachlor)；或苯基吡唑类,例如乙酰虫腈 (acetoprole)、pyrafluprole、pyriprole、氟吡唑虫 (vaniliprole)、维吉霉素 (sisapronil)；或异噁唑啉类,例如sarolaner、阿福拉纳 (afoxolaner)、lotilaner、氟雷拉纳 (fluralaner)；

[0796] 拟除虫菊酯类 (pyrethroids),例如 (顺-、反-) 甲氧苄氟菊酯 (metofluthrin)、丙氟菊酯 (profluthrin)、三氟醚菊酯 (flufenprox)、溴氟菊酯 (flubrocycythrinate)、fubfenprox、五氟苯菊酯 (fenfluthrin)、protrifenbut、反灭虫菊 (pyresmethrin)、RU15525、环戊烯丙菊酯 (terallethrin)、顺-苄呋菊酯 (cis-resmethrin)、heptafluthrin、bioethanomethrin、生物氯菊酯 (biopermethrin)、吡氯氰菊酯 (fenpyrithrin)、顺-氯氰菊酯 (cis-cypermethrin)、顺-苄氯菊酯 (cis-permethrin)、功夫菊酯 (cloxythrin)、 λ -氯氟氰菊酯 (cyhalothrin (lamda-))、chlovaporthrin,或卤代烃化合物 (HCHs),

[0797] 新烟碱类 (neonicotinoids),例如硝虫噻嗪 (nithiazine)

[0798] dicloromezotiaz、三氟苯嘧啶 (triflumezopyrim)

[0799] 大环内酯类,例如奈马克丁 (nemadectin)、伊维菌素 (ivermectin)、拉替菌素 (latidectin)、莫西菌素 (moxidectin)、塞拉菌素 (selamectin)、依立诺克丁 (eprinomectin)、多拉菌素 (doramectin)、甲胺基阿维菌素苯甲酸盐 (emamectin benzoate)；米尔贝肟 (milbemycin oxime)

[0800] 烯虫硫酯 (triprene)、保幼醚 (epofenonane)、苯虫醚 (diofenolan)；

[0801] 生物制剂、激素或信息素,例如天然产物,例如苏云金素 (thuringiensin)、十二碳二烯醇 (codlemone) 或印楝 (neem) 组分

[0802] 二硝基酚类,例如敌螨普 (dinocap)、消螨通 (dinobuton)、乐杀螨 (binapacryl)；

[0803] 苯甲酰脲类,例如氟佐隆 (fluazuron)、氟幼脲 (penfluron),

[0804] 脘衍生物类,例如chlormebuform、螨痹胺 (cymiazole)、得米地曲 (demiditraz)

[0805] 蜂巢瓦螨属杀螨剂类,例如有机酸类,例如甲酸、草酸。

[0806] 选自作为混合组分的杀体内寄生虫剂的示例性活性化合物包括,但不限于抗蠕虫活性化合物和抗原生动物活性化合物。

[0807] 抗蠕虫活性化合物包括但不限于下列杀线虫活性化合物、杀吸虫活性化合物和/或杀绦虫活性化合物：

[0808] 大环内酯类,例如：依立诺克丁 (eprinomectin)、阿维菌素 (abamectin)、奈马克丁 (nemadectin)、莫西菌素 (moxidectin)、多拉菌素 (doramectin)、塞拉菌素 (selamectin)、雷皮菌素 (lepimectin)、拉替菌素 (latidectin)、弥拜菌素 (milbemectin)、伊维菌素 (ivermectin)、埃玛菌素 (emamectin)、美倍霉素 (milbemycin)；

[0809] 苯并咪唑类和probenzimidazoles,例如：奥苯达唑 (oxibendazole)、甲苯咪唑 (mebendazole)、三氯苯达唑 (triclabendazole)、托布津 (thiophanate)、帕苯咪唑 (parbendazole)、奥芬达唑 (oxfendazole)、奈托比胺 (netobimin)、芬苯达唑 (fenbendazole)、苯硫氨酯 (febantel)、噻苯咪唑 (thiabendazole)、环苯达唑

(cyclobendazole)、坎苯达唑(cambendazole)、阿苯达唑亚砷(albendazole sulfoxide)、阿苯达唑(albendazole)、氟苯达唑(flubendazole)；

[0810] 缩肽类(depsipeptides), 优选环状缩肽类, 尤其是24元环状缩肽类, 例如: emodepside、PF1022A；

[0811] 四氢嘧啶类, 例如: 莫仑太尔(morantel)、噻嘧啶(pyrantel)、奥克太尔(oxantel)；

[0812] 咪唑并噻唑类, 例如: 丁咪唑(butamisole)、左旋咪唑(levamisole)、四咪唑(tetramisole)；

[0813] 氨基苯基脒类, 例如: 阿米太尔(amidantel)、脱酰阿米太尔(dAMD)、三苯双脒(tribendimidine)；

[0814] 氨基乙脒类, 例如: 莫奈太尔(monepantel)；

[0815] paraherquamides, 例如: paraherquamide、得曲恩特(derquantel)；

[0816] 水杨酰苯胺类(salicylanilides), 例如: 三溴沙仑(tribromsalan)、溴沙尼特(bromoxanide)、溴替尼特(brotianide)、氯碘沙尼(cloxanide)、氯生太尔(closantel)、氯硝柳胺(niclosamide)、羟氯扎胺(oxyclozanide)、雷复尼特(rafoxanide)；

[0817] 取代的酚类, 例如: 硝碘酚脒(nitroxynil)、硫氯酚(bithionol)、双碘硝酚(disophenol)、六氯芬(hexachlorophen)、硝氯酚(niclofolan)、meniclopholan；

[0818] 有机磷酸酯类, 例如: 三氯磷酸酯(trichlorfon)、naphthalofos、敌敌畏(dichlorvos)/DDVP、育畜磷(crufomate)、蝇毒磷(coumaphos)、哈洛克酮(haloxon)；

[0819] 哌嗪酮类/喹啉类, 例如: 吡喹酮(praziquantel)、依西太尔(epsiprantel)；

[0820] 哌嗪类, 例如: 哌嗪、羟嗪；

[0821] 四环素类, 例如: 四环素、氯四环素(chlorotetracycline)、多西霉素(doxycycline)、氧四环素(oxytetracycline)、罗利环素(rolitetracycline)；

[0822] 各种其他种类, 例如: 丁萘脒(bunamidine)、尼立达唑(niridazole)、雷琐太尔(resorantel)、omphalotin、奥替普拉(oltipraz)、硝硫氰酯(nitroscanate)、硝碘酚脒(nitroxynil)、奥沙尼喹(oxamniquin)、mirasan、盐酸卢甘宋(miracil)、硫蒽酮(lucanthone)、海恩酮(hycanthone)、海托林(hetolin)、依米丁(emetin)、乙胺嗪(diethylcarbamazine)、双氯芬、地芬尼泰(diamfenetide)、氯硝安定(clonazepam)、酚乙铵(bephenium)、硝硫氰胺(amoscanate)、氯舒隆(clorsulon)。

[0823] 抗原生动物活性化合物包括, 但不限于下列活性化合物:

[0824] 三嗪类, 例如: 地克珠利(diclazuril)、帕托珠利(ponazuril)、来曲珠利(letrazuril)、托曲珠利(toltrazuril)；

[0825] 聚醚离子载体类, 例如: 莫能菌素(monensin)、沙利霉素(salinomycin)、马杜霉素(maduramicin)、甲基盐霉素(narasin)；

[0826] 大环内酯类, 例如: 美尔贝霉素(milbemycin)、红霉素(erythromycin)；

[0827] 喹诺酮类, 例如: 恩诺沙星(enrofloxacin)、普多沙星(pradofloxacin)；

[0828] 奎宁类, 例如: 氯喹(chloroquin)；

[0829] 嘧啶类, 例如: 乙嘧啶(pyrimethamine)；

[0830] 磺胺类, 例如: 磺胺喹噁啉(sulfaquinoxaline)、甲氧苄氨嘧啶(trimethoprim)、

磺胺氯吡嗪 (sulfaclozin) ;

[0831] 硫胺素类,例如:氨丙啉 (amprolium) ;

[0832] 林可酰胺类 (lincosamides),例如:氯林肯霉素 (clindamycin) ;

[0833] 碳酰苯胺类,例如:咪多卡 (imidocarb) ;

[0834] 硝基咪喃类,例如:硝咪莫司 (nifurtimox) ;

[0835] 喹唑啉酮生物碱类,例如:卤夫酮 (halofuginone) ;

[0836] 各种其他种类,例如:奥沙尼喹 (oxamniquin)、巴龙霉素 (paromomycin) ;

[0837] 微生物疫苗或抗原类,例如:罗氏巴贝斯虫亚种 (*Babesia canis rossi*)、柔嫩艾美耳球虫 (*Eimeria tenella*)、早熟艾美耳球虫 (*Eimeria praecox*)、毒害艾美耳球虫 (*Eimeria necatrix*)、和缓艾美耳球虫 (*Eimeria mitis*)、巨型艾美耳球虫 (*Eimeria maxima*)、布氏艾美耳球虫 (*Eimeria brunetti*)、堆型艾美耳球虫 (*Eimeria acervulina*)、韦氏巴贝斯虫亚种 (*Babesia canis vogeli*)、婴儿利什曼虫 (*Leishmania infantum*)、犬巴贝斯虫亚种 (*Babesia canis canis*)、胎生网尾线虫 (*Dictyocaulus viviparus*)。

[0838] 根据具体情况,如果混合组分基于其官能团能够与合适的碱或酸形成盐,则提及的所有混合组分也可与合适的碱或酸形成盐。

[0839] 病媒防治 (vector control)

[0840] 式 (I) 的化合物还可用于病媒防治。在本发明的上下文中,病媒为能够将病原体 (例如病毒、蠕虫、单细胞生物和细菌) 从贮主 (reservoir) (植物、动物、人类等) 传播到宿主的节肢动物,尤其是昆虫或蛛形纲动物。病原体可被机械地传播至宿主 (例如通过非叮咬蝇 (non-stinging fly) 传播的沙眼) 或在注入后传播至宿主 (例如通过蚊子传播的疟原虫)。

[0841] 病媒及其传播的疾病或病原体的实例为:

[0842] 1) 蚊

[0843] -按蚊:疟疾、丝虫病;

[0844] -库蚊:日本脑炎、丝虫病、其他病毒性疾病、其他蠕虫的传播;

[0845] -伊蚊:黄热病、登革热、其他病毒性疾病、丝虫病;

[0846] -蚋科 (Simuliidae):蠕虫的传播、尤其是旋盘尾丝虫 (*Onchocerca volvulus*);

[0847] -毛蠓科 (Psychodidae):利什曼病的传播

[0848] 2) 虱:皮肤感染、流行性斑疹伤寒;

[0849] 3) 蚤:鼠疫、地方性斑疹伤寒、绦虫类;

[0850] 4) 蝇:昏睡病 (锥虫病);霍乱、其他细菌性疾病;

[0851] 5) 螨:螨病、流行性斑疹伤寒、立克次氏体痘、兔热病、圣路易斯脑炎、蜱媒脑炎 (TBE)、克里米亚-刚果出血热 (Crimean-Congo haemorrhagic fever)、疏螺旋体病 (borreliosis);

[0852] 6) 蜱:borellioses如伯氏疏螺旋体 (*Borrelia burgdorferi sensu lato.*)、达氏疏螺旋体 (*Borrelia duttoni*)、蜱媒脑炎、Q热 (贝氏柯克斯体 (*Coxiella burnetii*))、巴贝西虫病 (babesioses) (犬巴贝斯虫亚种)、埃里希体病 (ehrlichiosis)。

[0853] 在本发明的上下文中,病媒的实例为可将植物病毒传播到植物的昆虫,例如蚜虫、蝇、叶蝉或蓟马。能够传播植物病毒的其他病媒为叶螨、虱、甲虫和线虫。

[0854] 在本发明的上下文中,病媒的其他实例为可将病原体传播到动物和/或人类的昆

虫和蛛形纲动物如蚊,尤其是伊蚊属,按蚊属,例如冈比亚按蚊 (*A.gambiae*)、阿拉伯按蚊 (*A.arabiensis*)、不吉按蚊 (*A.funestus*)、大劣按蚊 (*A.dirus*) (疟疾),和库蚊属;毛蠓科 (*Psychodidae*) 如白蛉属 (*Phlebotomus*)、罗蛉属 (*Lutzomyia*);虱;蚤;蝇;螨和蜱。

[0855] 如果式 (I) 的化合物为破坏抗性 (*resistance-breaking*) 的,则病媒防治也是可行的。

[0856] 式 (I) 的化合物适用于预防由病媒传播的疾病和/或病原体。因此,本发明的另一个方面为式 (I) 的化合物用于病媒防治的用途,例如在农业、园艺、林业、花园和休闲设施中,以及在材料和贮存产品的保护中。

[0857] 工业材料保护

[0858] 式 (I) 的化合物适于保护工业材料免受昆虫的侵袭或破坏,所述昆虫例如来自鞘翅目 (*Coleoptera*)、膜翅目 (*Hymenoptera*)、等翅目 (*Isoptera*)、鳞翅目 (*Lepidoptera*)、啮虫目 (*Psocoptera*) 和衣鱼目 (*Zygentoma*)。

[0859] 在本上下文中,工业材料应理解为意指无生命材料,如优选塑料、胶粘剂、胶料、纸类和卡片、皮革、木材、加工的木制品和涂料组合物。特别优选本发明用于保护木材的用途。

[0860] 在另一个实施方案中,式 (I) 的化合物与至少一种其他杀昆虫剂和/或至少一种杀真菌剂一起使用。

[0861] 在另一个实施方案中,式 (I) 的化合物为即用型农药的形式,意指它们可不经进一步的修饰而应用于所述材料。有用的其他杀昆虫剂或杀真菌剂尤其包括上文中提及的那些。

[0862] 出人意料地,还已发现,式 (I) 的化合物可用于保护与盐水或微咸水接触的物体 (特别是船体、筛、网、建筑物、系泊用具和信号系统) 免受污损。同样地,式 (I) 的化合物可单独或与其他活性化合物结合用作抗污组合物。

[0863] 卫生领域中的动物类有害物的防治

[0864] 式 (I) 的化合物适于防治卫生领域中的动物类有害物。更具体而言,本发明可用于家用保护领域、卫生保护领域和贮存产品的保护中,特别是用于防治在封闭空间 (例如住宅、工厂车间、办公室、车辆舱室、动物饲养设施) 中遇到的昆虫、蛛形纲动物、蜱和螨。为防治动物类有害物,将式 (I) 的化合物单独使用或与其他活性化合物和/或助剂结合使用。它们优选用于家用杀昆虫剂产品中。式 (I) 的化合物对敏感和抗性物种以及对所有发育阶段均有效。

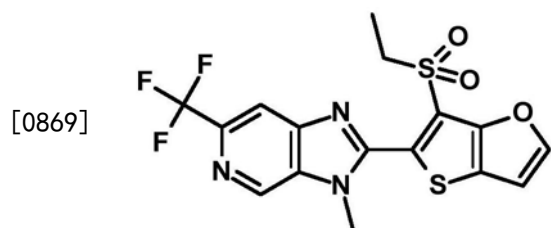
[0865] 这些有害物包括例如以下有害物:蛛形纲 (*Arachnida*),蝎目 (*Scorpiones*)、蜘蛛目 (*Araneae*) 和盲蛛目 (*Opiliones*);唇足纲 (*Chilopoda*) 和倍足纲 (*Diplopoda*);昆虫纲蜚蠊目 (*Blattodea*),鞘翅目 (*Coleoptera*)、革翅目 (*Dermaptera*)、双翅目 (*Diptera*)、异翅目 (*Heteroptera*)、膜翅目 (*Hymenoptera*)、等翅目 (*Isoptera*)、鳞翅目 (*Lepidoptera*)、虱目 (*Phthiraptera*)、啮虫目 (*Psocoptera*)、跳跃目 (*Saltatoria*) 或直翅目 (*Orthoptera*)、蚤目 (*Siphonaptera*) 和衣鱼目 (*Zygentoma*);以及软甲纲 (*Malacostraca*) 等足目 (*Isopoda*)。

[0866] 以下列形式进行施用:例如,气雾剂、无压喷雾产品 (例如泵式喷雾剂和雾化喷雾剂)、自动起雾体系、喷雾剂、泡沫剂、凝胶剂、具有由纤维素或塑料制成的蒸发片剂 (*evaporator tablet*) 的蒸发产品、液体蒸发剂、凝胶和薄膜蒸发剂、推进器驱动的蒸发剂、无动力或无源的蒸发体系、捕蛾纸、捕蛾袋和捕蛾胶,作为颗粒剂或粉剂,用于撒播的饵料

或饵站 (bait station) 中。

[0867] 制备实施例:

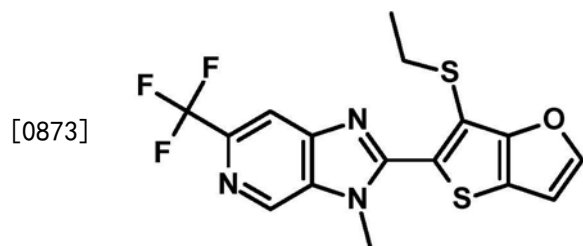
[0868] 2-[6-(乙基磺酰基)噻吩并[3,2-b]呋喃-5-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶 (实施例I-2)



[0870] 在室温下,将2-[6-(乙基磺烷基)噻吩并[3,2-b]呋喃-5-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶 (405mg, 1.05mmol) 溶于23mL DCM中。加入甲酸 (243mg, 5.28mmol) 和过氧化氢溶液 (浓度35%的水溶液; 719mg, 7.39mmol), 并将混合物搅拌12h。将浓度40%的亚硫酸氢钠溶液缓慢加入到反应溶液中, 并将混合物搅拌1h。将有机相取出, 用饱和碳酸氢钠溶液洗涤, 经硫酸钠干燥, 并在旋转蒸发仪上除去溶剂。将残余物通过以环己烷/乙酸乙酯梯度作为流动相的硅胶柱色谱法进行纯化。

[0871] MH^+ : 416; 1H -NMR (400MHz, d-DMSO) δ_{ppm} = 9.27 (s, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.23 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.53-3.47 (q, 2H), 1.19-1.16 (t, 3H)。

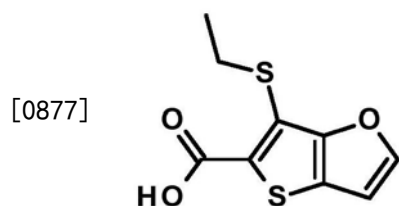
[0872] 2-[6-(乙基磺烷基)噻吩并[3,2-b]呋喃-5-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶 (实施例I-2)



[0874] 将6-(乙基磺烷基)噻吩并[3,2-b]呋喃-5-羧酸 (770mg, 2.69mmol) 溶于4mL二氯甲烷和0.02mL DMF中, 并冷却至0°C。滴加草酰氯 (321mg, 26.9mmol), 然后将混合物在室温下搅拌1h。将所有挥发性成分在旋转蒸发仪上除去。将粗产物溶于10mL的1,4-二噁烷中, 并缓慢滴加至N3-甲基-6-(三氟甲基)吡啶-3,4-二胺 (516mg, 2.69mmol) 于10mL二噁烷中的溶液中。将反应溶液在90°C下加热12h。冷却至室温后, 将硅胶加入溶液中, 并在旋转蒸发仪上除去溶剂。将残余物通过以环己烷/乙酸乙酯梯度作为流动相的硅胶柱色谱法进行纯化。

[0875] MH^+ : 384; 1H -NMR (400MHz, d-DMSO) δ_{ppm} = 9.21 (s, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.18 (d, 1H), 4.01 (s, 3H), 3.14-3.08 (q, 2H), 1.17-1.13 (t, 3H)。

[0876] 6-(乙基磺烷基)噻吩并[3,2-b]呋喃-5-羧酸

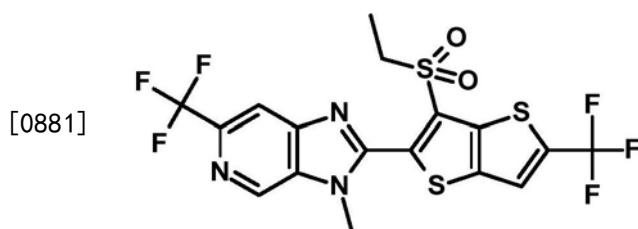


[0878] 在氩气气氛下, 将2,2,6,6-四甲基哌啶 (1.84g, 13mmol) 溶于50mL无水THF中并冷

却至-25℃。缓慢滴加正丁基锂(2.5M的己烷溶液,13mmol),并将混合物搅拌30min。将溶解在5mL THF中的噻吩并[3,2-b]呋喃-5-羧酸(1.00g,5.94mmol;市售可得)滴加到反应溶液中。在-25℃下搅拌30min后,滴加二乙基二硫醚(1.82g,14.8mmol),并将混合物再搅拌30min。将混合物缓慢温热至室温,然后在旋转蒸发仪上浓缩。将残余物溶于环己烷中,并通过过滤分离所得沉淀。将有机相用1N盐酸溶液洗涤两次,经硫酸钠干燥并除去溶剂。粗产物无需进一步纯化即用于后续的反应。

[0879] MH^+ : 229; ^1H-NMR (400MHz, d-DMSO) δ_{ppm} : 8.12-8.09 (m, 1H), 7.07 (m, 1H), 3.33 (m, 2H), 1.29 (t, 3H)。

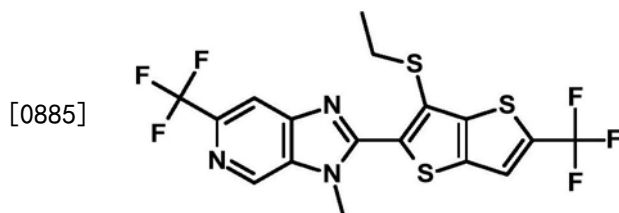
[0880] 2-[3-(乙基磺酰基)-5-(三氟甲基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(实施例I-3)



[0882] 在室温下,将2-[3-(乙基磺烷基)-5-(三氟甲基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(55mg,0.09mmol)溶于3mL DCM中。加入甲酸(22mg,0.48mmol)和过氧化氢溶液(浓度35%的水溶液;65mg,0.67mmol),并将混合物搅拌12h。将浓度40%的亚硫酸氢钠溶液缓慢加入到反应溶液中,并将混合物搅拌1h。将有机相取出,用饱和碳酸氢钠溶液洗涤,经硫酸钠干燥,并在旋转蒸发仪上除去溶剂。将残余物通过以环己烷/乙酸乙酯梯度作为流动相的硅胶柱色谱法进行纯化。

[0883] MH^+ : 501; ^1H-NMR (400MHz, d-DMSO) δ_{ppm} : 9.32 (s, 1H), 8.37 (m, 1H), 8.34 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.62-3.57 (q, 2H), 1.20-1.16 (t, 3H)。

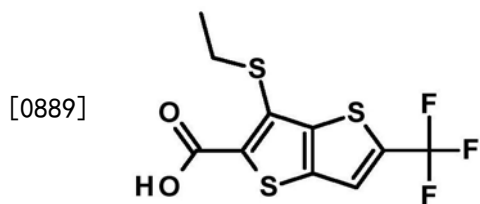
[0884] 2-[3-(乙基磺烷基)-5-(三氟甲基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(实施例I-3)



[0886] 将3-(乙基磺烷基)-5-(三氟甲基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-羧酸(768mg,2.45mmol)溶于4mL二氯甲烷和0.09mL DMF中,并冷却至0℃。滴加草酰氯(3120mg,24.5mmol),然后将混合物在室温下搅拌1h。将所有挥发性成分在旋转蒸发仪上除去。将粗产物溶于5mL的1,4-二噁烷中,并缓慢滴加至N3-甲基-6-(三氟甲基)吡啶-3,4-二胺(417mg,2.45mmol)于17mL二噁烷中的溶液中。将反应溶液在90℃下加热12h。冷却至室温后,在旋转蒸发仪上除去溶剂。将残余物溶于乙酸乙酯中并用水洗涤两次。将有机相经硫酸钠干燥并浓缩。将残余物通过柱色谱法经制备型HPLC纯化,其中水/乙腈梯度作为流动相。

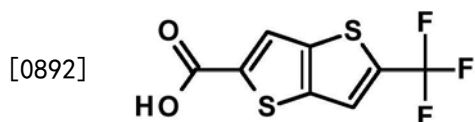
[0887] MH^+ : 468; ^1H-NMR (400MHz, d-DMSO) δ_{ppm} : 9.27 (s, 1H), 8.35 (m, 1H), 8.31 (m, 1H), 4.01 (s, 3H), 2.93-2.88 (q, 2H), 1.06-1.03 (t, 3H)。

[0888] 3-(乙基硫烷基)-5-(三氟甲基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-羧酸



[0890] 在氩气氛围下,将2,2,6,6-四甲基哌啶(1.127g,8.0mmol)溶于95mL无水THF中并冷却至-25℃。缓慢滴加正丁基锂(2.5M的己烷溶液,8.0mmol),并将混合物搅拌30min。将溶解在5mL THF中的5-(三氟甲基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-羧酸(0.915g,3.62mmol)滴加到反应溶液中。在-25℃下搅拌30min后,滴加二乙基二硫醚(1.109g,9.1mmol),并将混合物再搅拌30min。将混合物缓慢温热至室温,然后在旋转蒸发仪上浓缩。将残余物溶于环己烷中,并通过过滤分离所得沉淀。将有机相用1N盐酸溶液洗涤两次,经硫酸钠干燥并除去溶剂。粗产物无需进一步纯化即用于后续的反应。

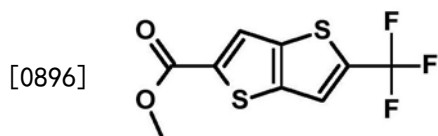
[0891] 5-(三氟甲基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-羧酸



[0893] 将5-(三氟甲基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-羧酸甲酯(1.0g,3.75mmol)溶于10mL THF中。加入溶于2mL水中的LiOH(179mg,7.51mmol)。将反应溶液在室温下搅拌12h。加入1N盐酸溶液并在旋转蒸发仪上除去有机溶剂。在水相中,形成沉淀物,将其通过过滤分离并风干。

[0894] M(neg):251;¹H-NMR(400MHz,d-DMSO)δppm:13.62(b-s,1H),8.23(s,1H),8.21(s,1H)。

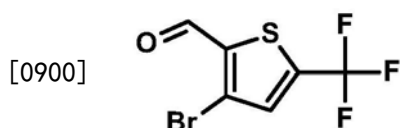
[0895] 5-(三氟甲基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-羧酸甲酯



[0897] 首先将3-溴-5-(三氟甲基)噻吩-2-甲醛(3.37g,13.0mmol)和碳酸钾(2.76g,20.0mmol)加入到50mL DMF中并加热到60℃。将巯基乙酸乙酯(1.4mL,13.0mmol)和催化量的18-冠-6醚滴加到该混合物中。将反应混合物搅拌12h,然后倒入500mL水中。将混合物用乙酸乙酯萃取三次。将合并的有机萃取物用饱和氯化钠溶液洗涤两次,用水洗涤一次,经硫酸镁干燥并浓缩。将残余物通过以环己烷/乙酸乙酯梯度作为流动相的硅胶柱色谱法进行纯化。

[0898] MH⁺:266;¹H-NMR(400MHz,CDCl₃)δppm:8.00(s,1H),7.65(s,1H),3.90(s,3H)。

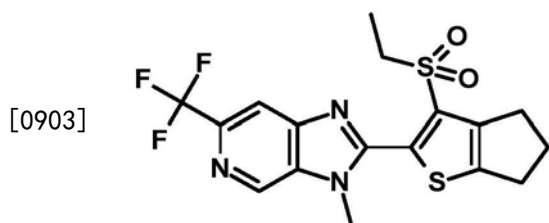
[0899] 3-溴-5-(三氟甲基)噻吩-2-甲醛



[0901] 在氩气下,将N,N-二异丙胺(6.00mL,42.3mmol)溶于24mL无水THF中。在-78℃下,滴加正丁基锂,并将混合物搅拌45min。然后滴加溶于24mL THF中的4-溴-2-(三氟甲基)噻

吩 (7.50g, 32.5mmol), 并将混合物搅拌1h。加入在30mL THF中的DMF (3.20mL, 41.5mmol), 将反应混合物搅拌1h并在此期间缓慢温热至室温。加入水, 并将混合物用乙酸乙酯萃取三次。将合并的有机萃取物经硫酸钠干燥并浓缩。将残余物通过以环己烷/乙酸乙酯梯度作为流动相的硅胶柱色谱法进行纯化。

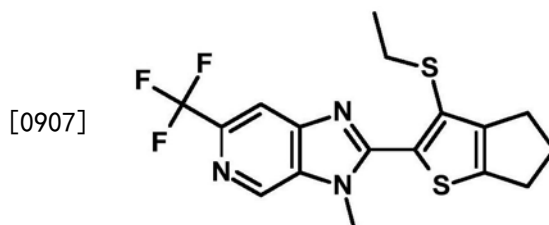
[0902] 2-[3-(乙基磺酰基)-5,6-二氢-4H-环戊二烯并[b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶 (实施例I-4)



[0904] 在室温下, 将2-[3-(乙基磺烷基)-5-(三氟甲基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶 (175mg, 0.41mmol) 溶于12mL DCM中。加入甲酸 (94mg, 2.05mmol) 和过氧化氢溶液 (浓度35%的水溶液; 279mg, 2.87mmol), 并将混合物搅拌12h。将浓度40%的亚硫酸氢钠溶液缓慢加入到反应溶液中, 并将混合物搅拌1h。将有机相取出, 用饱和碳酸氢钠溶液洗涤, 经硫酸钠干燥, 并在旋转蒸发仪上除去溶剂。将残余物通过以环己烷/乙酸乙酯梯度作为流动相的硅胶柱色谱法进行纯化。

[0905] MH^+ : 416; ^1H-NMR (400MHz, d-DMSO) δ_{ppm} : 9.24 (s, 1H), 8.26 (s, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.35-3.30 (m, 4H), 3.06-2.95 (m, 4H), 1.15-1.11 (t, 3H)。

[0906] 2-[3-(乙基磺烷基)-5,6-二氢-4H-环戊二烯并[b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶 (实施例I-4)

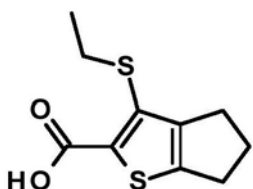


[0908] 将3-(乙基磺烷基)-5,6-二氢-4H-环戊二烯并[b]噻吩-2-羧酸 (465mg, 1.56mmol) 溶于4mL二氯甲烷和0.02mL DMF中, 并冷却至0°C。滴加草酰氯 (1992mg, 15.6mmol), 然后将混合物在室温下搅拌1h。将所有挥发性成分在旋转蒸发仪上除去。将粗产物溶于10mL的1,4-二噁烷中, 并缓慢滴加至N3-甲基-6-(三氟甲基)吡啶-3,4-二胺 (300mg, 1.56mmol) 于10mL二噁烷中的溶液中。将反应溶液在90°C下加热12h。冷却至室温后, 在旋转蒸发仪上除去溶剂。将残余物溶于乙酸乙酯中并用水洗涤两次。将有机相经硫酸钠干燥并浓缩。将残余物通过柱色谱法经制备型HPLC使用水/乙腈梯度作为流动相进行纯化。

[0909] MH^+ : 384; ^1H-NMR (400MHz, $CDCl_3$) δ_{ppm} : 9.18 (s, 1H), 8.22 (s, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.32 (m, 2H), 3.02-2.99 (m, 2H), 2.83-2.80 (m, 2H), 2.77-2.71 (m, 2H), 1.05-1.01 (t, 3H)。

[0910] 3-(乙基磺烷基)-5,6-二氢-4H-环戊二烯并[b]噻吩-2-羧酸

[0911]

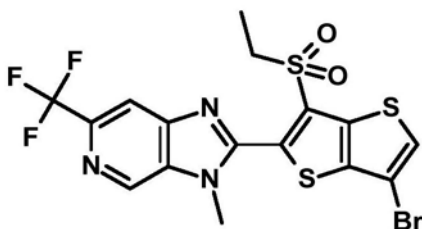


[0912] 在氩气气氛下,将2,2,6,6-四甲基哌啶(1.847g,13.0mmol)溶于20mL无水THF中并冷却至-25℃。缓慢滴加正丁基锂(2.5M的己烷溶液,13.0mmol),并将混合物搅拌30min。将溶解在5mL THF中的5,6-二氢-4H-环戊二烯并[b]噻吩-2-羧酸(1.00g,5.94mmol)滴加到反应溶液中。在-25℃下搅拌30min后,滴加二乙基二硫醚(1.816g,14.8mmol),并将混合物再搅拌30min。将混合物缓慢温热至室温,然后在旋转蒸发仪上浓缩。将残余物溶于环己烷中,并将所得沉淀通过过滤分离。将有机相用1N盐酸溶液洗涤两次,经硫酸钠干燥并除去溶剂。粗产物无需进一步纯化即用于后续的反应。

[0913] MH^+ : 229; ^1H-NMR (400MHz, $CDCl_3$) δ_{ppm} : 3.06-3.01 (q, 2H), 2.90-2.68 (m, 6H), 1.17-1.14 (t, 3H)。

[0914] 2-[6-溴-3-(乙基磺酰基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(实施例I-8)

[0915]

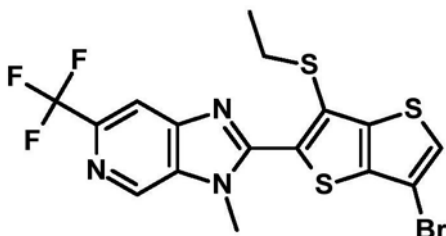


[0916] 在室温下,将2-[6-溴-3-(乙基硫烷基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(435mg,0.81mmol)溶于23mL DCM中。加入甲酸(188mg,4.09mmol)和过氧化氢溶液(浓度35%的水溶液;556mg,5.72mmol),并将混合物搅拌12h。将浓度40%的亚硫酸氢钠溶液缓慢加入到反应溶液中,并将混合物搅拌1h。将有机相取出,用饱和碳酸氢钠溶液洗涤,经硫酸钠干燥,并在旋转蒸发仪上除去溶剂。将残余物通过以环己烷/乙酸乙酯梯度作为流动相的硅胶柱色谱法进行纯化。

[0917] MH^+ : 511; ^1H-NMR (400MHz, $CDCl_3$) δ_{ppm} : 9.29 (s, 1H), 8.32 (s, 1H), 7.91 (s, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.58-3.51 (q, 2H), 1.19-1.14 (t, 3H)。

[0918] 2-[6-溴-3-(乙基硫烷基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(实施例I-8)

[0919]

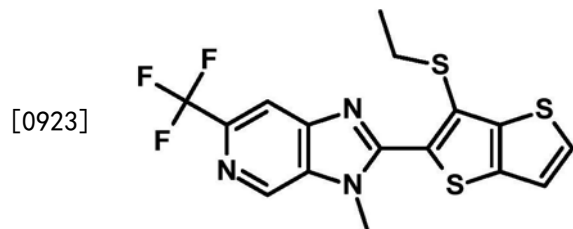


[0920] 将2-[3-(乙基硫烷基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(1.18g,2.95mmol)溶于35mL四氢呋喃中。在排除光线的情况下,加入N-溴代琥珀酰亚胺(788.6mg,4.43mmol),并将混合物搅拌12h。将反应混合物用乙酸乙酯稀释,

并用1N硫代硫酸钠溶液洗涤。将有机相取出,经硫酸钠干燥,并在旋转蒸发仪上除去溶剂。将粗产物通过柱色谱法(SiO_2 、环己烷、乙酸乙酯)纯化。

[0921] MH^+ : 480; $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ_{ppm} : 9.25 (s, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.87 (s, 1H), 4.00 (s, 3H), 2.91-2.85 (q, 2H), 1.06-1.02 (t, 3H)。

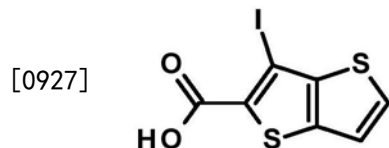
[0922] 2-[3-(乙基硫烷基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶



[0924] 将2-(3-碘噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基)-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(1.80g, 3.86mmol)、乙硫醇(480.8mg, 7.73mmol)、三(二亚苄基丙酮)二钯(0)(177mg, 0.19mmol)、Xantphos(223.9mg, 0.38mmol)和二异丙基乙胺(0.85mg, 6.57mmol)溶于无水二噁烷中,并在氩气气氛下,在80℃下加热3h。冷却至室温后,将硅胶加入反应混合物中,并在旋转蒸发仪上除去溶剂。将在硅胶上的粗产物通过柱色谱法(SiO_2 、环己烷/乙酸乙酯)纯化。

[0925] MH^+ : 400; $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ_{ppm} : 9.24 (s, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.96-7.795 (d, 1H), 7.65-7.64 (d, 1H), 4.00 (s, 3H), 2.95-2.89 (q, 2H), 1.07-1.04 (t, 3H)。

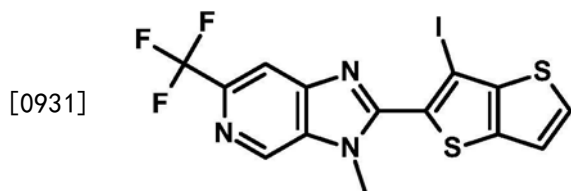
[0926] 3-碘噻吩并[3,2-b]噻吩-2-羧酸



[0928] 在氩气气氛下,将噻吩并[3,2-b]噻吩-2-羧酸甲酯(5.00g, 25.2mmol)溶于20mL无水四氢呋喃中。将溶液冷却至-60℃,并缓慢滴加四甲基哌啶氯化镁氯化锂络合物(6.11g, 25.2mmol, 溶解的1M的甲苯/四氢呋喃溶液)。在-60℃下搅拌1h后,滴加碘(6.40g, 25.2mmol, 溶于10mL四氢呋喃中)。将混合物缓慢温热至室温,并加入200mL饱和氯化铵溶液。分离出有机相,在旋转蒸发仪上除去溶剂,并将粗产物3-碘噻吩并[3,2-b]噻吩-2-羧酸甲酯直接用于后续的反应。

[0929] 将3-碘噻吩并[3,2-b]噻吩-2-羧酸甲酯(8.1g, 25mmol)溶于100mL THF中,并加入在20mL水中的氢氧化锂(2.99g, 125mmol)。将反应混合物在室温下剧烈搅拌12h。将混合物用1N盐酸中和,并加入水。形成沉淀物(3-碘噻吩并[3,2-b]噻吩-2-羧酸),将其通过过滤分离。

[0930] 2-(3-碘噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基)-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶

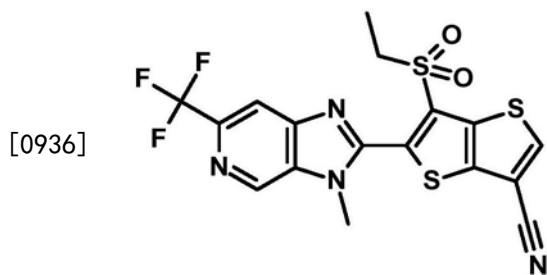


[0932] 将3-碘噻吩并[3,2-b]噻吩-2-羧酸(3.24g, 10.4mmol)溶于4mL二氯甲烷中。在0℃下,加入0.02mL二甲基甲酰胺和草酰氯(13mg, 104mmol)。将反应混合物在室温下搅拌1h,然后加热回流1h。将所有挥发性成分在旋转蒸发仪上除去,并将残留的酰氯溶于10mL 1,4-二噁烷中。

[0933] 将N3-甲基-6-(三氟甲基)吡啶-3,4-二胺(2.00g, 10.4mmol)溶于10mL二噁烷中,并缓慢滴加所述酰氯。将反应混合物加热至90℃,保持12h。冷却后,形成晶体,将其通过过滤分离。浓缩母液,并将残余物通过柱色谱法(SiO₂、环己烷/乙酸乙酯)纯化。

[0934] MH⁺: 465; ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δppm: 9.27 (s, 1H), 8.31 (s, 1H), 7.99-7.98 (d, 1H), 7.81-7.80 (d, 1H), 4.01 (s, 3H)。

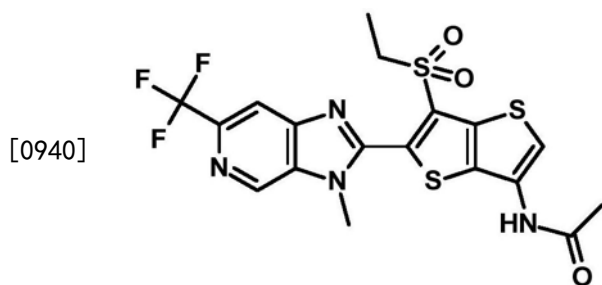
[0935] 6-(乙基磺酰基)-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]噻吩并[3,2-b]噻吩-3-甲腈(实施例I-5)



[0937] 将2-[6-溴-3-(乙基磺酰基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(50mg, 0.09mmol)、氧化锌(11.5mg, 0.09mmol)、三(二亚苄基丙酮)二钯(0)(1.8mg, 0.002mmol)和1,1'-双(二苯基膦)二茂铁x DCM(“dppf x DCM”, 1.6mg, 0.02mmol)溶于2mL DMF中,并在微波中在180℃下加热15min。将反应混合物用MTBE稀释,并用饱和碳酸氢钠溶液洗涤两次。将有机相经硫酸钠干燥,并在旋转蒸发仪上除去溶剂。将残余物通过柱色谱法(SiO₂、环己烷/乙酸乙酯)纯化。

[0938] MH⁺: 457; ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δppm: 9.32 (s, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.35 (s, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.62-3.57 (q, 2H), 1.19-1.15 (t, 3H)。

[0939] N-{6-(乙基磺酰基)-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]噻吩并[3,2-b]噻吩-3-基}乙酰胺(实施例I-6)

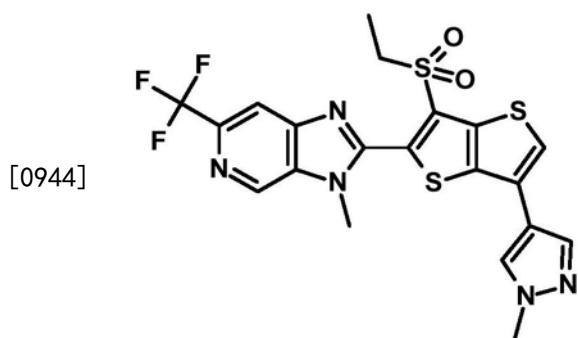


[0941] 将2-[6-溴-3-(乙基磺酰基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-

3H-咪唑并[4,5-c]吡啶 (50mg, 0.09mmol)、乙酰胺 (58mg, 0.98mmol)、三(二亚苄基丙酮)二钯(0) (9mg, 0.01mmol)、碳酸铯 (48mg, 0.15mmol)、三氯甲烷 (12mg, 0.1mmol) 和 Xantphos (6mg, 0.01mmol) 溶于 5mL 二噁烷中, 并在 100°C 下加热 4h。冷却至室温后, 将反应溶液直接通过制备型 HPLC 纯化。

[0942] MH^+ : 489; ^1H-NMR (400MHz, $CDCl_3$) δ ppm: 11.72 (s, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.19 (s, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.54-3.48 (q, 2H), 2.16 (s, 3H), 1.24-1.14 (t, 3H)。

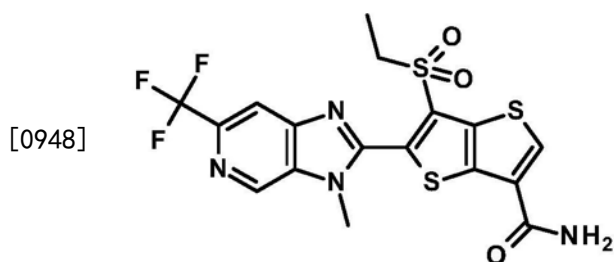
[0943] 2-[3-(乙基磺酰基)-6-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶 (实施例 I-11)



[0945] 在氩气气氛下, 将 2-[6-溴-3-(乙基磺酰基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶 (100mg, 0.196mmol)、1-甲基-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷(dioxaborolan)-2-基)-1H-吡唑 (45mg, 0.216mmol)、四(三苯基膦)钯(0) (11mg, 0.01mmol) 和碳酸钠 (83mg, 0.78mmol) 溶于 3mL 二噁烷中, 并在 100°C 下加热 12h。

[0946] MH^+ : 512; ^1H-NMR (400MHz, $CDCl_3$) δ ppm: 9.29 (s, 1H), 8.31 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.73 (s, 1H), 5.76 (s, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 3.58-3.53 (q, 2H), 1.20-1.17 (t, 3H)。

[0947] 6-(乙基磺酰基)-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]噻吩并[3,2-b]噻吩-3-甲酰胺 (实施例 I-15)



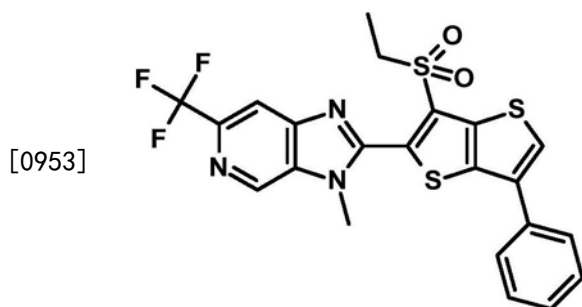
[0949] 在 25mL 的高压釜中, 将 2-[6-溴-3-(乙基磺酰基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶 (200mg, 0.39mmol) 溶于 5mL 甲醇, 并加入乙酸钠 (60mg, 0.733mmol) 和二氯[1,1-双(二苯基膦)二茂铁]钯(II)丙酮加合物(“J&M Pd-107”, 60mg, 0.076mmol)。将该装置用氩气冲洗 3 次。然后将混合物在 40°C 下在 5 巴的一氧化碳压力下搅拌 18h。通过过滤除去所有固体后, 将有机相浓缩, 并将粗产物 6-(乙基磺酰基)-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]噻吩并[3,2-b]噻吩-3-羧酸甲酯通过制备型 HPLC 纯化。

[0950] 将 6-(乙基磺酰基)-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]噻

吩并[3,2-b]噻吩-3-羧酸甲酯(29mg,0.06mmol)溶于1mL甲醇和1mL四氢呋喃中,并加入氨(152mg,2.96mmol,33%,水溶液)。将混合物在室温下搅拌12h。加入硅胶后,除去所有挥发性成分,并将在硅胶上的粗产物通过柱色谱法纯化。

[0951] MH^+ : 475; ^1H-NMR (400MHz, $CDCl_3$) δ ppm: 9.30 (s, 1H), 8.36 (b-s, 1H), 8.33 (s, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.76 (b-s, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.57-3.51 (q, 2H), 1.18-1.15 (t, 3H)。

[0952] 2-[3-(乙基磺酰基)-6-苯基噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(实施例I-16)

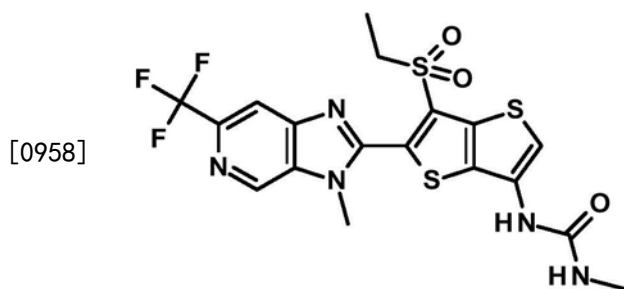


[0954] 将2-[6-溴-3-(乙基硫烷基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(150mg,0.31mmol)、苯基硼酸(152mg,1.25mmol)、乙酸钡(7mg,0.031mmol)、S-Phos(26mg,0.06mmol)和磷酸钾(333mg,1.568mmol)溶于6mL甲苯和3mL THF中。将混合物加热回流7h。冷却至室温后,加入硅胶,并将所有挥发性成分在旋转蒸发仪上除去。将在硅胶上的残余物2-[3-(乙基硫烷基)-6-苯基噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶通过柱色谱法纯化。

[0955] 在室温下,2-[3-(乙基硫烷基)-6-苯基噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(77mg,0.15mmol)溶于23mL DCM中。加入甲酸(37mg,0.8mmol)和过氧化氢溶液(浓度35%的水溶液;110mg,1.13mmol),并将混合物搅拌12h。将浓度40%的亚硫酸氢钠溶液缓慢加入到反应溶液中,并将混合物搅拌1h。将有机相取出,用饱和碳酸氢钠溶液洗涤,经硫酸钠干燥,并在旋转蒸发仪上除去溶剂。将残余物通过以环己烷/乙酸乙酯梯度作为流动相的硅胶柱色谱法进行纯化。

[0956] MH^+ : 508; ^1H-NMR (400MHz, $CDCl_3$) δ ppm: 9.30 (s, 1H), 8.33 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.81-7.79 (m, 2H), 7.54-7.50 (m, 2H), 7.46-7.43 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.60-3.53 (q, 2H), 1.22-1.18 (t, 3H)。

[0957] 1-{6-(乙基磺酰基)-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]噻吩并[3,2-b]噻吩-3-基}-3-甲基脲(实施例I-17)

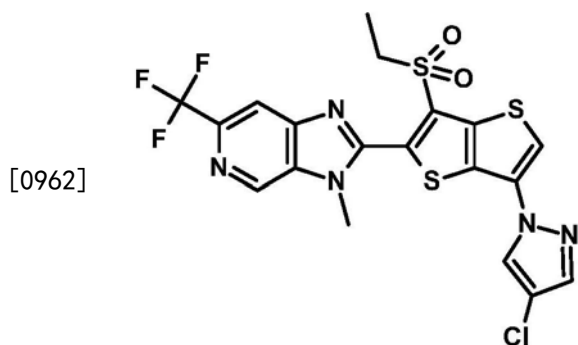


[0959] 在氩气气氛下,将2-[6-溴-3-(乙基磺酰基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(50mL,0.1mmol)、N-甲基脲(9mg,0.118mmol)、碳酸

铯 (48mg, 0.15mmol)、4,5-双(二苯基膦)-9,9-二甲基氧杂蒽 (6mg, 0.01mmol) 和三(二亚苄基丙酮)二钯(0)溶于5mL无水脱气的二噁烷中,并在80℃下加热4h。冷却至室温后,将混合物通过制备型HPLC纯化。

[0960] MH^+ : 504; ^1H-NMR (400MHz, $CDCl_3$) δ ppm: 9.25 (s, 1H), 8.28 (s, 1H), 6.96 (s, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.53-3.47 (q, 2H), 2.71-2.67 (m, 3H), 1.18-1.14 (t, 3H)。

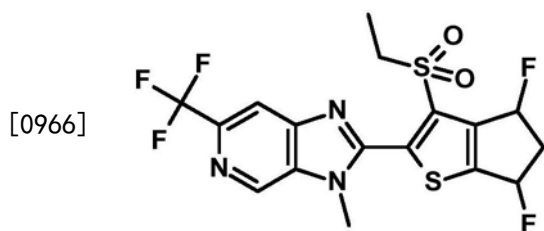
[0961] 2-[6-(4-氯-1H-吡唑-1-基)-3-(乙基磺酰基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(实施例I-20)



[0963] 在压力容器中,将2-[6-溴-3-(乙基磺酰基)噻吩并[3,2-b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶 (100mg, 0.19mmol)、4-氯-1H-吡唑 (22mg, 0.216mmol)、碘化铜(I) (4mg, 0.02mmol)、反式-N,N'-二甲基环己烷-1,2-二胺 (6mg, 0.04mmol)、碘化钾 (10mg, 0.06mmol) 和碳酸钾 (81mg, 0.6mmol) 溶于10mL无水二噁烷中并脱气。关闭反应容器,并在搅拌下将混合物在130℃下加热5h。冷却至室温后,将所有固体成分滤出并将溶液浓缩。将残余物通过柱色谱法纯化(环己烷、乙酸乙酯)。

[0964] MH^+ : 533; ^1H-NMR (400MHz, $CDCl_3$) δ ppm: 9.30 (s, 1H), 8.95 (s, 1H), 8.32 (s, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.61-3.56 (q, 2H), 1.21-1.17 (t, 3H)。

[0965] 2-[3-(乙基磺酰基)-4,6-二氟-5,6-二氢-4H-环戊二烯并[b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶(实施例I-29)



[0967] 在10mL Schlenk容器中,在氩气气氛下,将2-[3-(乙基磺酰基)-5,6-二氢-4H-环戊二烯并[b]噻吩-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-c]吡啶 (50mg, 0.12mmol)、过硫酸钾 (49mg, 0.18mmol) 和Selectfluor (85mg, 0.24mmol) 溶于1.2mL乙腈和1.2mol水中。用隔膜封闭容器,并将反应溶液在80℃下加热3h。将混合物用二氯甲烷稀释,并通过经疏水过滤器(water-repellent filter)过滤除去水相。除去溶剂后,将粗产物通过制备型HPLC纯化。

[0968] 通过这种方式,除了实施例I-33,实施例化合物I-26、I-27、I-28、I-30也分别作为副产物分离。

[0969] ^1H-NMR (400MHz, $CDCl_3$) δ ppm: 9.10 (s, 1H), 8.19 (s, 1H), 6.10-6.09 (m, 1H), 6.01-

6.00 (m, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.41-3.32 (q, 4H), 1.25-1.22 (t, 3H)。

[0970] 在酸性范围通过LC-MS测定M⁺在pH 2.7下使用流动相0.1%的甲酸水溶液和乙腈(含有0.1%的甲酸)进行;线性梯度从10%乙腈至95%乙腈,仪器:Agilent 1100LC系统、Agilent MSD系统、HTS PAL。

[0971] 在中性范围通过LC-MS测定M⁺在pH 7.8下使用流动相0.001摩尔的碳酸氢铵水溶液和乙腈进行;线性梯度从10%乙腈至95%乙腈。

[0972] 所选实施例的NMR数据以常规形式(δ 值、多重分裂、氢原子数)或作为NMR峰列表列出。

[0973] 在每种情况下,说明了在其中记录NMR谱的溶剂。

[0974] NMR峰列表方法

[0975] 所选实施例的¹H NMR数据以¹H NMR峰列表的形式说明。对于每个信号峰,首先列出以ppm计的 δ 值,然后在圆括号中列出信号强度。对于不同的信号峰, δ 值-信号强度数对通过分号彼此间隔列出。

[0976] 因此,一个实施例的峰列表具有以下形式:

[0977] δ_1 (强度₁); δ_2 (强度₂); ……; δ_i (强度_i); ……; δ_n (强度_n)

[0978] 尖峰信号的强度与NMR谱的打印实例中以cm计的信号高度相关,并且显示了信号强度的真实比例。在宽峰信号的情况下,可以显示信号的几个峰或中间峰以及其与谱图中的最强信号相比的相对强度。

[0979] 为校准¹H NMR谱的化学位移,使用四甲基硅烷和/或溶剂的化学位移,特别是在DMSO中测量的谱图的情况下。因此,四甲基硅烷峰可以但不一定在NMR峰列表中出现。

[0980] ¹H NMR峰的列表与常规的¹H NMR打印件相似,因此通常包含在常规的NMR说明中列出的所有峰。

[0981] 此外,与常规¹H NMR打印件一样,它们可显示溶剂信号、目标化合物的立体异构体(其同样由本发明提供)的信号和/或杂质的峰。

[0982] 在记录在溶剂和/或水的 δ 范围内的化合物信号时,我们的¹H NMR峰的列表显示出标准的溶剂峰,例如在DMSO-D₆中的DMSO的峰和水的峰,其通常具有平均较高的强度。

[0983] 目标化合物的立体异构体的峰和/或杂质的峰通常具有比目标化合物(例如具有>90%的纯度)的峰平均更低的强度。

[0984] 此类立体异构体和/或杂质对于特定的制备方法可以是特有的。因此,通过参考“副产物指纹(by-product fingerprints)”,它们的峰可有助于识别我们的制备方法的再现性。

[0985] 通过已知方法(MestreC, ACD模拟,以及凭经验评估的预期值)计算目标化合物的峰的专业人员可视需要任选地使用其他强度过滤器来分离目标化合物的峰。这种分离与在常规的¹H NMR说明中挑选所述峰类似。

[0986] ¹H NMR峰列表的其他详情可参见研究公开数据库(Research Disclosure Database)第564025号。

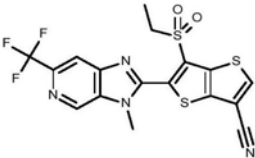
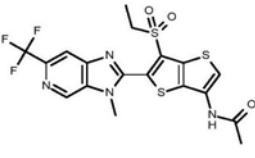
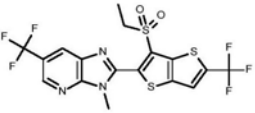
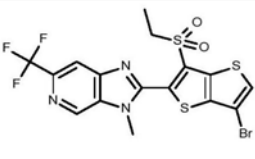
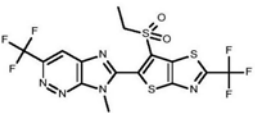
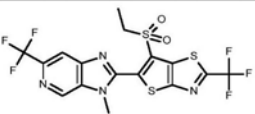
[0987] 表1中列出的化合物如上所述或类似地制备。

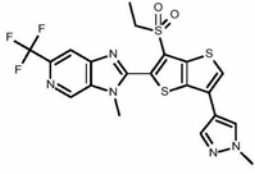
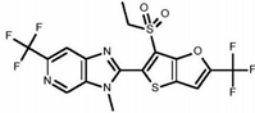
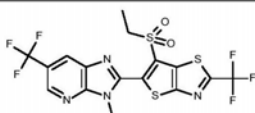
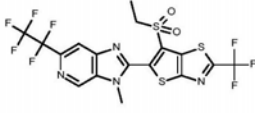
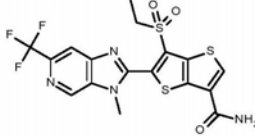
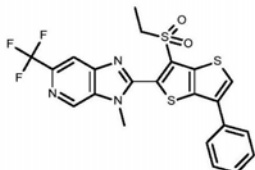
[0988] 表1:

[0989]

实施例	结构	
I-1		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2923 (4.0); 8.3186 (4.3); 8.0416 (3.4); 8.0282 (3.7); 7.7090 (3.7); 7.6956 (3.5); 5.7565 (11.0); 3.9335 (16.0); 3.5450 (1.1); 3.5265 (3.6); 3.5081 (3.6); 3.4897 (1.1); 3.3430 (0.6); 3.3254 (15.7); 3.0145 (0.4); 2.9263 (0.4); 2.5077 (26.6); 2.5033 (35.0); 2.4988 (26.3); 1.9899 (0.6); 1.3968 (0.7); 1.2399 (0.5); 1.2232 (0.4); 1.1797 (4.0); 1.1613 (8.6); 1.1428 (3.8); 0.0079 (1.2); -0.0002 (27.6); -0.0083 (1.2)
I-2		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2665 (4.4); 8.2922 (4.6); 8.2366 (3.9); 8.2314 (4.0); 7.2544 (4.0); 7.2492 (3.9); 5.7573 (2.7); 3.9144 (16.0); 3.5319 (1.2); 3.5135 (3.8); 3.4950 (3.9); 3.4766 (1.2); 3.3238 (4.6); 2.5079 (16.3); 2.5038 (21.2); 2.4996 (16.2); 1.9905 (0.6); 1.1951 (4.1); 1.1766 (8.7); 1.1582 (4.0); -0.0002 (15.2); -0.0082 (0.7)
I-3		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.3168 (4.4); 8.3739 (3.2); 8.3721 (3.4); 8.3431 (4.6); 5.7561 (8.2); 3.9551 (16.0); 3.6257 (1.1); 3.6073 (3.6); 3.5889 (3.6); 3.5705 (1.1); 3.3251 (8.3); 2.5093 (16.6); 2.5051 (22.1); 2.5011 (17.0); 1.3966 (0.9); 1.2007 (3.9); 1.1823 (8.4); 1.1639 (3.8); 0.0078 (0.7); -0.0002 (18.0)
I-4		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2369 (4.2); 8.2612 (4.4); 5.7567 (7.4); 4.0394 (0.6); 4.0216 (0.6); 3.8595 (16.0); 3.3509 (1.2); 3.3322 (4.8); 3.3259 (12.8); 3.3141 (3.9); 3.2956 (1.2); 3.2438 (0.7); 3.0624 (1.3); 3.0444 (2.4); 3.0260 (1.5); 2.9885 (1.4); 2.9704 (2.6); 2.9522 (1.7); 2.5351 (0.7); 2.5080 (16.8); 2.5037 (22.1); 2.4993 (17.7); 2.4804 (1.6); 2.4623 (0.5); 1.9901 (2.5); 1.2349 (0.5); 1.2183 (0.4); 1.2148 (0.5); 1.1940 (0.8); 1.1761 (1.4); 1.1583 (0.8); 1.1466 (4.1); 1.1283 (8.3); 1.1098 (3.7); 0.0078 (0.7); -0.0002 (15.7)

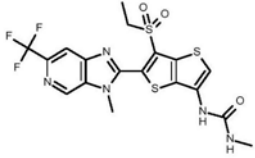
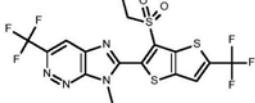
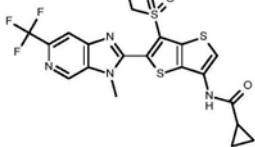
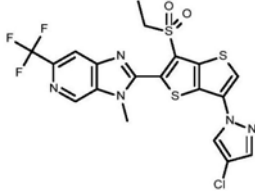
[0990]

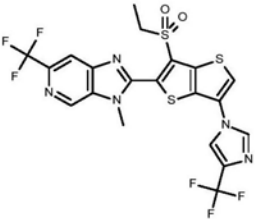
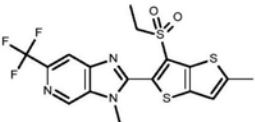
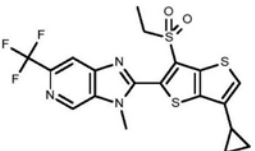
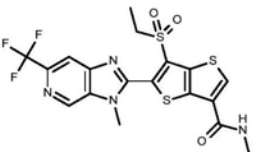
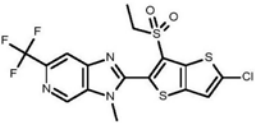
I-5		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.3153 (3.9); 8.5427 (7.0); 8.3465 (4.1); 4.0379 (0.4); 4.0199 (0.5); 3.9489 (16.0); 3.6216 (1.0); 3.6031 (3.4); 3.5846 (3.5); 3.5662 (1.0); 3.3206 (108.3); 2.6750 (0.8); 2.6706 (1.2); 2.6661 (0.9); 2.5238 (3.7); 2.5103 (72.3); 2.5060 (149.8); 2.5015 (200.3); 2.4971 (146.0); 2.4928 (72.4); 2.3327 (0.8); 2.3283 (1.2); 2.3237 (0.8); 1.9885 (2.0); 1.1910 (3.9); 1.1725 (8.5); 1.1540 (3.7); 0.1459 (0.7); 0.0078 (5.6); -0.0002 (154.0); -0.0082 (7.0); -0.1499 (0.7)
I-6		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11.7220 (3.0); 9.2646 (3.8); 8.3139 (0.6); 8.2912 (4.1); 8.2223 (0.4); 7.3822 (0.3); 7.3348 (0.4); 7.1941 (7.7); 5.7540 (2.5); 3.9231 (16.0); 3.8235 (1.1); 3.5683 (0.6); 3.5379 (1.2); 3.5193 (3.6); 3.5008 (3.6); 3.4828 (1.2); 3.3891 (0.4); 3.3263 (349.8); 2.6758 (1.3); 2.6713 (1.8); 2.6667 (1.3); 2.5244 (5.6); 2.5111 (105.8); 2.5067 (218.4); 2.5022 (290.7); 2.4977 (208.4); 2.4933 (100.2); 2.3335 (1.1); 2.3287 (1.6); 2.3243 (1.3); 2.1581 (15.7); 1.7955 (0.8); 1.2350 (1.0); 1.1787 (4.0); 1.1604 (8.7); 1.1419 (3.8); 1.0695 (0.4); 0.1463 (0.6); 0.0079 (4.9); -0.0002 (137.7); -0.0084 (5.6); -0.1496 (0.6)
I-7		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.9267 (2.1); 8.9233 (2.2); 8.7334 (2.2); 8.7297 (2.2); 8.3760 (2.9); 8.3730 (2.9); 3.8390 (16.0); 3.6497 (0.9); 3.6313 (3.2); 3.6129 (3.3); 3.5944 (1.0); 3.3234 (112.2); 2.6755 (0.4); 2.6710 (0.6); 2.6665 (0.4); 2.5244 (1.4); 2.5196 (2.2); 2.5109 (36.0); 2.5065 (76.6); 2.5020 (103.0); 2.4974 (73.6); 2.4930 (35.0); 2.3332 (0.4); 2.3287 (0.6); 2.3241 (0.4); 1.3974 (9.0); 1.2046 (3.4); 1.1862 (7.9); 1.1677 (3.4); -0.0002 (8.8)
I-8		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2938 (3.8); 8.3197 (4.1); 7.9110 (8.3); 5.7557 (6.6); 3.9348 (16.0); 3.5834 (1.0); 3.5650 (3.4); 3.5465 (3.5); 3.5279 (1.0); 3.3246 (28.6); 2.5257 (0.5); 2.5120 (12.6); 2.5077 (26.5); 2.5032 (35.6); 2.4987 (25.4); 2.4943 (12.0); 1.3969 (0.4); 1.1819 (3.6); 1.1636 (8.2); 1.1450 (3.5); -0.0002 (7.5)
I-9		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.8310 (6.2); 4.0295 (16.0); 3.6745 (1.0); 3.6561 (3.4); 3.6376 (3.5); 3.6192 (1.1); 3.3220 (212.9); 2.6752 (0.9); 2.6707 (1.2); 2.6662 (0.9); 2.5241 (3.2); 2.5104 (75.2); 2.5061 (157.1); 2.5017 (211.6); 2.4972 (154.5); 2.4929 (76.3); 2.3329 (0.8); 2.3286 (1.2); 2.3243 (0.9); 1.3978 (1.3); 1.2199 (3.7); 1.2015 (8.1); 1.1830 (3.6); 0.0079 (1.0); -0.0002 (30.0); -0.0084 (1.4)
I-10		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.3233 (4.1); 8.3606 (4.4); 3.9749 (16.0); 3.6723 (1.0); 3.6541 (3.5); 3.6356 (3.6); 3.6171 (1.1); 3.3643 (313.8); 3.3568 (283.6); 3.3501 (289.0); 2.6775 (0.7); 2.6728 (1.0); 2.6685 (0.8); 2.5261 (2.3); 2.5126 (63.6); 2.5082 (137.6); 2.5037 (188.1); 2.4992

		(135.2); 2.4948 (64.1); 2.3348 (0.7); 2.3303 (1.0); 2.3258 (0.8); 1.3975 (1.3); 1.2339 (0.8); 1.2121 (3.8); 1.1937 (8.4); 1.1753 (3.7); -0.0001 (10.9); -0.0084 (0.5)
I-11		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2875 (4.0); 8.3139 (4.2); 8.2682 (4.6); 7.9011 (5.0); 7.7291 (7.4); 5.7566 (8.7); 3.9494 (16.0); 3.8996 (14.8); 3.5810 (1.0); 3.5625 (3.4); 3.5441 (3.5); 3.5257 (1.0); 3.3270 (23.6); 2.5259 (0.5); 2.5125 (13.1); 2.5081 (27.5); 2.5037 (36.7); 2.4992 (26.5); 2.4949 (12.8); 1.2035 (3.7); 1.1852 (8.4); 1.1667 (3.6); -0.0002 (6.2)
I-12		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2855 (4.5); 8.3147 (4.8); 7.9349 (3.7); 4.0383 (0.7); 4.0205 (0.7); 3.9186 (16.0); 3.5473 (1.2); 3.5290 (3.9); 3.5105 (3.9); 3.4921 (1.3); 3.3197 (33.6); 2.6712 (0.6); 2.5021 (94.7); 2.3285 (0.6); 1.9889 (2.9); 1.3977 (0.8); 1.2082 (4.2); 1.1899 (9.0); 1.1716 (4.5); 1.1576 (1.0); -0.0002 (31.1)
I-13		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.9376 (2.2); 8.9340 (2.4); 8.7501 (2.3); 8.7458 (2.3); 3.8668 (16.0); 3.7054 (1.0); 3.6870 (3.4); 3.6685 (3.4); 3.6501 (1.0); 3.3231 (115.2); 2.6758 (0.5); 2.6712 (0.6); 2.6667 (0.5); 2.5245 (1.6); 2.5110 (38.8); 2.5066 (81.6); 2.5022 (109.6); 2.4977 (79.3); 2.4934 (38.5); 2.3333 (0.4); 2.3289 (0.6); 2.3243 (0.4); 1.3978 (0.4); 1.2232 (3.6); 1.2048 (8.0); 1.1863 (3.4); 0.0080 (0.5); -0.0001 (16.6); -0.0083 (0.7)
I-14		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.3480 (4.0); 8.3905 (4.2); 3.9763 (16.0); 3.6813 (1.0); 3.6629 (3.5); 3.6444 (3.5); 3.6260 (1.1); 3.3227 (46.0); 2.6714 (0.3); 2.5246 (0.8); 2.5112 (21.3); 2.5068 (44.8); 2.5023 (60.4); 2.4979 (43.9); 2.4936 (21.6); 2.3292 (0.3); 1.3976 (8.8); 1.2161 (3.7); 1.1976 (8.4); 1.1792 (3.6); -0.0002 (9.1); -0.0083 (0.4)
I-15		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.3002 (3.8); 8.3558 (0.7); 8.3283 (4.2); 8.3151 (1.2); 8.2424 (6.6); 7.7570 (0.7); 3.9394 (16.0); 3.5652 (1.0); 3.5470 (3.4); 3.5285 (3.5); 3.5101 (1.1); 3.3209 (120.6); 2.6753 (0.8); 2.6708 (1.1); 2.6662 (0.8); 2.5242 (2.7); 2.5107 (66.1); 2.5063 (138.9); 2.5018 (186.6); 2.4973 (134.2); 2.4929 (64.7); 2.3330 (0.8); 2.3287 (1.1); 2.3241 (0.8); 1.9888 (1.0); 1.3359 (0.4); 1.2985 (0.3); 1.2590 (0.4); 1.2496 (0.6); 1.1927 (0.4); 1.1835 (3.7); 1.1750 (1.0); 1.1651 (8.4); 1.1467 (3.6); 0.1459 (0.5); 0.0080 (4.5); -0.0001 (128.5); -0.0084 (5.1); -0.1498 (0.5)
I-16		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2995 (2.6); 8.3256 (2.8); 8.1062 (4.6); 7.8076 (1.4); 7.8043 (2.0); 7.7863 (2.3); 7.5415 (1.0); 7.5234 (2.3); 7.5039 (1.6); 7.4620 (1.0); 7.4437 (1.2); 7.4250 (0.4); 3.9592 (10.6); 3.5979 (0.7); 3.5795 (2.3); 3.5610 (2.3); 3.5426 (0.7); 3.3199 (36.1); 2.6754 (0.5); 2.6709 (0.7); 2.6663 (0.5); 2.5242 (2.0); 2.5193 (3.3); 2.5108 (41.8); 2.5064 (86.0); 2.5019 (113.5);

[0991]

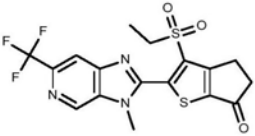
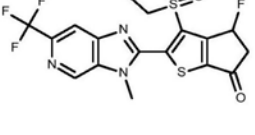
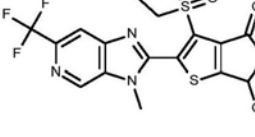
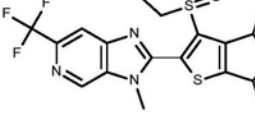
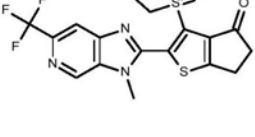
[0992]

		2.4974 (81.2); 2.4931 (39.4); 2.3332 (0.5); 2.3286 (0.6); 2.3241 (0.5); 1.3977 (16.0); 1.2172 (2.5); 1.1988 (5.6); 1.1804 (2.4); 0.1460 (0.5); 0.0078 (3.9); -0.0003 (105.3); -0.0086 (4.1); -0.1497 (0.5)
I-17		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10.3150 (1.0); 9.2518 (1.7); 8.2798 (1.9); 6.9546 (2.0); 6.4475 (0.3); 6.4355 (0.3); 5.7552 (2.1); 3.9189 (7.1); 3.6202 (0.3); 3.6093 (0.4); 3.5275 (0.5); 3.5091 (1.5); 3.4906 (1.5); 3.4722 (0.5); 3.3253 (157.4); 3.1781 (0.4); 3.1517 (0.4); 3.1402 (0.4); 3.1328 (0.4); 3.1217 (0.4); 2.7050 (2.8); 2.6935 (2.8); 2.6755 (0.8); 2.6711 (1.1); 2.6665 (0.8); 2.5243 (3.1); 2.5108 (65.9); 2.5065 (137.1); 2.5020 (183.6); 2.4975 (132.4); 2.4931 (64.2); 2.3333 (0.7); 2.3287 (1.0); 2.3241 (0.8); 1.6804 (0.4); 1.6732 (0.4); 1.6629 (0.4); 1.5511 (1.2); 1.5363 (1.2); 1.5215 (0.7); 1.3371 (16.0); 1.2828 (2.9); 1.2647 (5.2); 1.2522 (2.6); 1.2475 (3.5); 1.2344 (1.4); 1.1800 (1.8); 1.1616 (3.8); 1.1432 (1.7); 0.1458 (0.3); 0.0080 (2.8); -0.0002 (81.4); -0.0083 (3.4); -0.1496 (0.4)
I-18		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.8098 (6.2); 8.3860 (3.0); 8.3841 (3.0); 5.7554 (2.6); 5.7547 (2.5); 4.3521 (0.7); 4.0124 (16.0); 3.6352 (1.0); 3.6168 (3.5); 3.5983 (3.6); 3.5799 (1.1); 3.3489 (4.3); 2.5256 (0.4); 2.5121 (10.6); 2.5080 (21.9); 2.5036 (29.3); 2.4992 (21.2); 2.4950 (10.3); 1.3965 (0.4); 1.3172 (0.4); 1.2084 (3.7); 1.1900 (8.2); 1.1716 (3.7); 0.0071 (0.5); -0.0002 (15.8); -0.0083 (0.6)
I-19		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 11.9715 (0.8); 10.2040 (0.5); 9.2640 (3.8); 8.2920 (4.0); 7.3838 (0.4); 7.2120 (7.2); 3.9247 (16.0); 3.8247 (0.4); 3.5683 (0.4); 3.5325 (1.0); 3.5233 (0.4); 3.5142 (3.4); 3.4957 (3.4); 3.4772 (1.1); 3.3334 (313.1); 2.6764 (0.7); 2.6720 (1.0); 2.6674 (0.7); 2.5253 (2.6); 2.5205 (4.2); 2.5119 (54.6); 2.5075 (114.8); 2.5029 (154.1); 2.4984 (110.3); 2.4939 (52.8); 2.3342 (0.7); 2.3297 (0.9); 2.3251 (0.6); 2.0739 (0.6); 1.8601 (0.5); 1.8551 (0.6); 1.8424 (1.0); 1.8293 (0.6); 1.8241 (0.6); 1.7555 (0.7); 1.6488 (0.3); 1.1732 (3.8); 1.1548 (8.6); 1.1363 (3.7); 0.9367 (2.5); 0.9179 (4.8); 0.9078 (3.2); 0.0080 (2.6); -0.0002 (78.4); -0.0084 (3.0)
I-20		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2965 (3.9); 8.9462 (5.8); 8.3234 (4.2); 8.3150 (0.4); 8.0008 (5.8); 7.9242 (7.2); 5.7553 (0.9); 3.9572 (16.0); 3.6134 (0.9); 3.5951 (3.4); 3.5766 (3.5); 3.5581 (1.0); 3.3225 (141.4); 2.6757 (0.6); 2.6709 (0.9); 2.6665 (0.7); 2.5242 (2.0); 2.5194 (3.3); 2.5108 (55.4); 2.5064 (118.0); 2.5019 (160.2); 2.4974 (115.4); 2.4930 (55.8); 2.3332 (0.6); 2.3286 (0.9); 2.3241 (0.7); 1.2064 (3.6); 1.1880 (8.2); 1.1695 (3.6); 0.1460 (0.4); 0.0078 (3.4); -0.0003 (102.1); -0.0086 (4.1); -0.1497 (0.4)

I-21		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.3095 (4.4); 8.5568 (3.2); 8.5211 (3.8); 8.3357 (4.9); 8.3126 (0.4); 8.0353 (6.8); 3.9570 (16.0); 3.6198 (1.2); 3.6024 (3.6); 3.5837 (3.8); 3.5650 (1.2); 3.3832 (0.5); 3.3218 (254.9); 2.6689 (1.5); 2.5321 (0.8); 2.5046 (189.0); 2.5006 (244.7); 2.4968 (180.9); 2.4494 (0.4); 2.3273 (1.3); 2.0726 (0.4); 1.2144 (3.8); 1.1962 (8.2); 1.1779 (3.8); 0.1441 (0.6); 0.0061 (4.3); -0.0014 (113.1); -0.1518 (0.6)
I-22		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2780 (3.7); 8.3141 (0.4); 8.3027 (3.9); 7.4142 (3.1); 7.4113 (3.0); 3.9200 (16.0); 3.5258 (1.0); 3.5073 (3.5); 3.4889 (3.6); 3.4704 (1.1); 3.3185 (76.2); 2.6750 (0.9); 2.6706 (1.2); 2.6660 (0.9); 2.6613 (0.5); 2.6402 (9.4); 2.6380 (9.2); 2.5238 (3.5); 2.5104 (70.1); 2.5060 (139.8); 2.5016 (181.0); 2.4970 (129.6); 2.4926 (62.8); 2.3373 (0.4); 2.3327 (0.8); 2.3282 (1.1); 2.3238 (0.8); 1.3978 (13.8); 1.1709 (3.7); 1.1525 (8.3); 1.1340 (3.6); 0.1459 (0.7); 0.0076 (5.6); -0.0002 (147.1); -0.0083 (6.3); -0.1498 (0.7)
I-23		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2738 (3.7); 8.3004 (4.0); 7.4136 (4.5); 7.4122 (4.9); 3.9306 (0.4); 3.9132 (16.0); 3.5245 (1.0); 3.5061 (3.5); 3.4877 (3.5); 3.4693 (1.1); 3.3199 (67.2); 2.6751 (0.6); 2.6706 (0.9); 2.6661 (0.6); 2.5239 (2.5); 2.5191 (4.1); 2.5105 (57.4); 2.5061 (120.2); 2.5016 (161.1); 2.4971 (117.2); 2.4927 (58.3); 2.3681 (0.4); 2.3556 (0.6); 2.3471 (0.7); 2.3343 (1.6); 2.3282 (1.4); 2.3237 (1.4); 2.3149 (0.7); 2.3018 (0.4); 1.3976 (2.2); 1.3356 (0.4); 1.2981 (0.4); 1.2586 (0.6); 1.2494 (0.7); 1.2350 (1.1); 1.1674 (4.0); 1.1490 (10.4); 1.1375 (1.6); 1.1307 (4.7); 1.1170 (1.0); 0.8655 (1.0); 0.8546 (2.7); 0.8494 (2.5); 0.8425 (2.3); 0.8371 (2.8); 0.8257 (0.8); 0.1459 (0.7); 0.0079 (5.8); -0.0002 (158.2); -0.0084 (6.5); -0.1497 (0.7)
I-24		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.3012 (3.9); 8.8724 (0.4); 8.8625 (1.2); 8.8509 (1.2); 8.8418 (0.4); 8.3272 (4.1); 8.2057 (6.8); 5.7556 (2.5); 4.0387 (0.8); 4.0209 (0.8); 3.9439 (16.0); 3.5717 (1.0); 3.5532 (3.4); 3.5347 (3.5); 3.5164 (1.0); 3.3257 (42.6); 2.8394 (6.3); 2.8280 (6.3); 2.5255 (0.7); 2.5121 (15.3); 2.5077 (32.0); 2.5032 (43.2); 2.4987 (31.3); 2.4943 (15.3); 1.9895 (3.5); 1.3367 (0.5); 1.2592 (0.5); 1.2500 (0.7); 1.2354 (0.5); 1.1935 (1.2); 1.1865 (3.7); 1.1757 (2.4); 1.1681 (8.4); 1.1580 (1.4); 1.1496 (3.6); 0.0079 (2.1); -0.0002 (55.2); -0.0084 (2.5)
I-25		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2952 (3.7); 8.3200 (3.9); 7.8315 (7.7); 5.7553 (3.7); 3.9373 (16.0); 3.5890 (1.0); 3.5706 (3.4); 3.5521 (3.5); 3.5337 (1.0); 3.3215 (9.3); 2.5256 (0.6); 2.5208 (0.9); 2.5121 (12.5); 2.5077 (25.8); 2.5032 (34.0); 2.4987 (24.3); 2.4942 (11.7); 1.9896 (0.6); 1.1856 (3.7); 1.1761 (0.7); 1.1673 (8.3); 1.1585 (0.6); 1.1488 (3.6); 0.0079 (1.2); -0.0002 (35.0); -0.0085

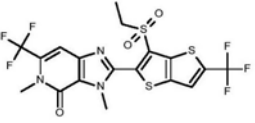
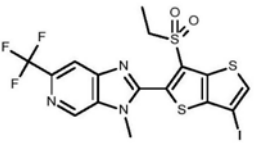
[0993]

[0994]

I-26		<p>(1.2)</p> <p>¹H-NMR(600.1 MHz, CD₃CN):</p> <p>δ= 9.1098 (2.8); 8.1952 (2.9); 8.1941 (2.9); 3.9006 (16.0); 3.3766 (1.2); 3.3642 (3.7); 3.3518 (3.8); 3.3395 (1.2); 3.3267 (2.2); 3.3235 (1.2); 3.3218 (1.3); 3.3185 (2.2); 3.3149 (1.3); 3.3132 (1.2); 3.3102 (2.4); 3.0380 (2.5); 3.0349 (1.2); 3.0334 (1.4); 3.0297 (2.2); 3.0263 (1.4); 3.0249 (1.1); 3.0214 (2.2); 2.5335 (0.7); 2.1834 (2.4); 1.9805 (2.1); 1.9764 (4.0); 1.9722 (5.6); 1.9681 (3.8); 1.9640 (1.9); 1.2790 (3.8); 1.2667 (7.9); 1.2543 (3.7)</p>
I-27		<p>¹H-NMR(601.6 MHz, CD₃CN):</p> <p>δ= 9.1213 (2.8); 8.2075 (3.0); 6.4363 (0.7); 6.4342 (0.7); 6.4260 (0.7); 6.4240 (0.7); 6.3483 (0.7); 6.3463 (0.7); 6.3381 (0.7); 6.3361 (0.7); 3.9045 (16.0); 3.5439 (0.6); 3.5337 (0.6); 3.5219 (0.6); 3.5121 (1.1); 3.5021 (0.7); 3.4904 (0.7); 3.4801 (0.7); 3.4267 (0.7); 3.4194 (0.5); 3.4145 (1.7); 3.4071 (1.6); 3.4022 (1.7); 3.3948 (1.7); 3.3898 (0.6); 3.3827 (0.7); 3.2118 (0.8); 3.2097 (0.8); 3.1802 (0.6); 3.1782 (0.7); 3.1741 (0.8); 3.1721 (0.8); 3.1426 (0.6); 3.1406 (0.6); 2.5308 (6.5); 2.1568 (13.5); 1.9932 (0.6); 1.9851 (0.6); 1.9808 (0.9); 1.9771 (12.8); 1.9730 (25.0); 1.9689 (37.0); 1.9649 (25.2); 1.9607 (12.7); 1.2825 (3.2); 1.2701 (6.6); 1.2578 (3.2)</p>
I-28		<p>¹H-NMR(601.6 MHz, CD₃CN):</p> <p>δ= 9.0821 (1.9); 8.1842 (2.0); 8.1830 (2.0); 5.5609 (0.3); 5.5541 (0.6); 5.5504 (0.6); 5.5436 (0.3); 4.2584 (0.8); 4.2478 (0.8); 3.8910 (12.1); 3.5839 (0.4); 3.5720 (1.2); 3.5598 (1.6); 3.5478 (1.2); 3.5358 (0.4); 3.4524 (0.8); 3.4417 (0.8); 3.4218 (0.9); 3.4111 (0.9); 2.9434 (0.9); 2.9395 (0.9); 2.9128 (0.8); 2.9089 (0.8); 2.5317 (16.0); 2.1631 (33.4); 1.9929 (0.6); 1.9847 (0.6); 1.9805 (0.9); 1.9768 (16.6); 1.9727 (32.1); 1.9686 (48.4); 1.9645 (33.2); 1.9604 (17.0); 1.2266 (2.7); 1.2142 (5.9); 1.2019 (2.7)</p>
I-29		<p>¹H-NMR(601.6 MHz, CD₃CN):</p> <p>δ= 9.0965 (1.9); 8.1888 (2.0); 6.1025 (0.7); 6.0920 (0.7); 6.0109 (0.5); 6.0091 (0.5); 6.0009 (0.5); 3.8899 (0.4); 3.8796 (12.1); 3.4062 (0.4); 3.3956 (0.4); 3.3685 (0.5); 3.3589 (0.9); 3.3469 (2.4); 3.3345 (2.4); 3.3221 (0.8); 2.7776 (0.4); 2.7505 (0.4); 2.5312 (16.0); 2.1616 (38.1); 1.9930 (0.6); 1.9849 (0.6); 1.9806 (1.0); 1.9769 (15.3); 1.9729 (28.8); 1.9687 (41.7); 1.9646 (29.0); 1.9605 (14.9); 1.2478 (2.5); 1.2355 (5.1); 1.2231 (2.5)</p>
I-30		<p>¹H-NMR(601.6 MHz, CD₃CN):</p> <p>δ= 9.0828 (0.7); 9.0708 (2.4); 8.1740 (3.3); 3.8843 (16.0); 3.8731 (4.5); 3.5944 (0.8); 3.5820 (2.3); 3.5697 (2.4); 3.5573 (0.8); 3.3538 (2.1); 3.3492 (1.0); 3.3454 (2.1); 3.3412 (1.1); 3.3367 (2.3); 3.3332 (0.7); 3.3319 (0.7); 3.3205 (0.7); 3.0843 (2.2); 3.0801 (1.2); 3.0758 (1.9); 3.0719 (1.1); 3.0673 (2.0); 2.5309 (7.4); 2.1646 (7.8); 1.9808 (0.3); 1.9770 (5.6); 1.9729 (10.7); 1.9688 (15.4); 1.9647 (10.3); 1.9606 (5.4);</p>

		1.2425 (0.9); 1.2302 (1.8); 1.2226 (3.7); 1.2179 (1.0); 1.2102 (7.8); 1.1979 (3.6)
I-31		¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2749 (3.7); 8.3005 (3.9); 7.4135 (4.6); 7.4121 (4.8); 7.2811 (0.4); 7.2794 (0.4); 5.7559 (1.3); 3.9154 (16.0); 3.5262 (1.0); 3.5078 (3.5); 3.4893 (3.6); 3.4709 (1.0); 3.3642 (0.3); 3.3231 (21.0); 2.5253 (1.0); 2.5204 (1.6); 2.5118 (16.9); 2.5074 (33.0); 2.5028 (43.4); 2.4982 (32.5); 2.4938 (16.4); 2.3559 (0.6); 2.3475 (0.6); 2.3351 (1.3); 2.3290 (0.6); 2.3242 (0.8); 2.3147 (0.6); 1.1692 (3.9); 1.1507 (9.6); 1.1381 (1.7); 1.1327 (5.2); 1.1283 (3.1); 1.1176 (1.0); 0.8664 (0.9); 0.8555 (2.5); 0.8503 (2.4); 0.8433 (2.3); 0.8380 (2.8); 0.8267 (0.8); 0.0080 (0.3); -0.0002 (9.0); -0.0085 (0.3)
I-32		: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.3182 (3.5); 8.8420 (2.9); 8.8390 (2.8); 8.3454 (3.8); 8.3436 (3.7); 7.2639 (0.7); 7.2457 (0.7); 7.1889 (0.9); 7.1719 (0.7); 7.1558 (0.4); 4.3404 (0.3); 4.3274 (0.7); 4.3145 (0.4); 3.9585 (16.0); 3.6241 (1.0); 3.6056 (3.4); 3.5871 (3.4); 3.5688 (1.0); 3.3919 (0.4); 3.3759 (0.8); 3.3630 (0.8); 3.3600 (0.5); 3.3466 (0.5); 3.3221 (50.1); 2.6758 (0.4); 2.6712 (0.6); 2.6665 (0.5); 2.5797 (0.5); 2.5607 (0.8); 2.5411 (0.7); 2.5247 (2.3); 2.5198 (3.6); 2.5112 (38.8); 2.5068 (75.8); 2.5022 (99.3); 2.4976 (73.8); 2.4931 (37.1); 2.3337 (0.5); 2.3291 (0.6); 2.3246 (0.5); 1.9890 (0.4); 1.5783 (0.3); 1.5590 (0.5); 1.5396 (0.4); 1.4522 (0.4); 1.4361 (0.4); 1.4160 (0.5); 1.3977 (4.8); 1.3127 (0.4); 1.2953 (0.5); 1.2046 (3.6); 1.1862 (8.3); 1.1754 (0.7); 1.1677 (3.5); 0.0080 (0.7); -0.0002 (19.9); -0.0084 (0.7)
I-33		¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.7948 (2.6); 8.7899 (2.9); 8.7097 (2.6); 8.7049 (2.2); 8.3724 (1.1); 8.3694 (2.8); 8.3664 (2.7); 3.8180 (16.0); 3.6492 (0.9); 3.6307 (3.1); 3.6123 (3.1); 3.5938 (0.9); 3.3237 (75.8); 2.6757 (0.5); 2.6711 (0.7); 2.6665 (0.5); 2.5247 (2.2); 2.5199 (3.2); 2.5112 (40.8); 2.5067 (82.7); 2.5022 (107.4); 2.4976 (75.6); 2.4930 (35.3); 2.3335 (0.5); 2.3289 (0.7); 2.3244 (0.5); 1.2046 (3.4); 1.1862 (8.0); 1.1678 (3.3); 0.0079 (1.2); -0.0002 (36.9); -0.0086 (1.1)
I-34		¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.1931 (2.7); 9.1879 (3.0); 9.0993 (2.5); 9.0943 (2.3); 8.3772 (2.8); 8.3743 (2.8); 3.8724 (16.0); 3.6468 (0.9); 3.6283 (3.2); 3.6099 (3.3); 3.5915 (1.0); 3.3225 (30.4); 2.6716 (0.4); 2.5251 (1.2); 2.5202 (1.9); 2.5114 (25.5); 2.5071 (51.9); 2.5026 (68.1); 2.4980 (49.0); 2.4936 (23.7); 2.3293 (0.4); 2.0750 (1.4); 1.2090 (3.6); 1.1907 (8.3); 1.1722 (3.5); 0.0080 (0.6); -0.0002 (19.6); -0.0085 (0.6)
I-35		¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.9823 (2.3); 8.9777 (2.4); 8.7830 (2.2); 8.7786 (2.1); 8.3775 (1.1); 8.3746 (2.7); 8.3715 (2.7); 3.8515 (16.0); 3.6583 (0.8); 3.6398 (2.9); 3.6213 (3.0); 3.6028 (0.9); 3.3231 (33.9); 2.6714 (0.4); 2.5249

[0995]

		(1.2); 2.5201 (1.9); 2.5115 (24.8); 2.5070 (51.0); 2.5025 (67.0); 2.4978 (47.6); 2.4933 (22.6); 2.3293 (0.4); 2.0747 (2.7); 1.2108 (3.5); 1.1924 (8.1); 1.1739 (3.4); 0.0079 (0.7); -0.0002 (22.8); -0.0086 (0.7)
[0996]		I-36 ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.3549 (1.2); 8.3519 (3.1); 8.3489 (2.9); 8.3144 (0.4); 7.4718 (4.2); 3.9856 (16.0); 3.6299 (6.8); 3.5531 (1.0); 3.5347 (3.4); 3.5163 (3.4); 3.4979 (1.0); 3.3207 (28.8); 2.6758 (0.5); 2.6712 (0.7); 2.6667 (0.5); 2.5247 (2.3); 2.5199 (3.5); 2.5113 (42.7); 2.5068 (85.8); 2.5023 (111.2); 2.4977 (78.1); 2.4932 (36.6); 2.3335 (0.5); 2.3292 (0.7); 2.3245 (0.5); 2.0742 (1.0); 1.1746 (3.5); 1.1563 (8.0); 1.1378 (3.4); -0.0002 (1.4)
		I-37 ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2868 (3.5); 8.3145 (4.2); 7.9659 (8.1); 5.7553 (1.2); 3.9243 (16.0); 3.5609 (1.0); 3.5424 (3.4); 3.5240 (3.4); 3.5055 (1.0); 3.3227 (267.8); 3.2995 (0.4); 2.6797 (0.7); 2.6751 (1.5); 2.6706 (2.0); 2.6660 (1.5); 2.6617 (0.7); 2.5241 (6.2); 2.5194 (9.5); 2.5107 (121.5); 2.5062 (247.6); 2.5017 (325.2); 2.4971 (231.4); 2.4925 (110.2); 2.3371 (0.6); 2.3330 (1.4); 2.3285 (2.0); 2.3239 (1.4); 2.3195 (0.6); 1.3508 (0.6); 1.2587 (0.3); 1.2347 (1.0); 1.1704 (3.6); 1.1520 (8.2); 1.1335 (3.4); 0.0081 (0.4); -0.0001 (13.2); -0.0085 (0.4)

[0997] 应用实施例

[0998] 猫栉首蚤——与成年猫蚤的体外接触试验

[0999] 为了涂覆试管,首先将9mg活性化合物溶于1mL分析纯丙酮中,然后用分析纯丙酮稀释至所需浓度。通过在定轨振动器上旋转和摇动(在30rpm下摇动旋转2h),将250 μ L溶液均匀分布在25mL玻璃管的内壁和底部上。如果均匀分布,用900ppm的活性化合物溶液和44.7cm²的内表面积可得到基于面积计(area-based)5 μ g/cm²的剂量。

[1000] 在溶剂蒸发后,在试管中放入5-10只成年猫蚤(猫栉首蚤),用带孔的塑料盖密封并在室温和环境湿度下水平放置培育。48h后,测定功效。为此,将试管直立并将蚤敲落到试管底部。将在底部保持静止或以不协调的方式移动的蚤视为死亡或将要死亡。

[1001] 在该试验中,如果在5 μ g/cm²的施用率下达到至少80%的功效,则物质对猫栉首蚤显示出良好的功效。100%的功效意指所有蚤均死亡或将要死亡。0%的功效意指没有蚤受到伤害。

[1002] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在5 μ g/cm²(=500gai/ha)的施用率下显示出100%的功效:I-10

[1003] 猫栉首蚤——口服试验

[1004] 溶剂:二甲基亚砜

[1005] 为了制备合适的活性化合物制剂,将10mg活性化合物与0.5mL二甲基亚砜混合。用柠檬酸化的牛血稀释,得到所需浓度。

[1006] 将约20只未喂食的成年猫蚤(猫栉首蚤)放入顶部和底部用纱布(gauze)密封的腔室内。将底端用石蜡膜密封的金属圆筒放置在腔室上。圆筒中含有血液/活性化合物制剂,其可透过石蜡膜被蚤吸食。

[1007] 2天后,测定以%计的杀死率。100%意指所有蚤都已被杀死;0%意指没有蚤被杀死。

[1008] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100ppm的施用率下显示出100%的功效:I-18

[1009] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100ppm的施用率下显示出95%的功效:I-7

[1010] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100ppm的施用率下显示出80%的功效:I-10、I-12

[1011] 铜绿蝇试验

[1012] 溶剂:二甲基亚砷

[1013] 为了制备合适的活性化合物制剂,将10mg活性化合物与0.5mL二甲基亚砷混合,并用水将该浓液稀释至所需浓度。

[1014] 将约20只澳大利亚绵羊绿头蝇 (Australian sheep blowfly) (铜绿蝇) 的L1幼虫转移到含有切碎的马肉和所需浓度的活性化合物制剂的试验容器中。

[1015] 2天后,测定以%计的杀死率。100%意指所有的幼虫都已被杀死;0%意指没有幼虫被杀死。

[1016] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100ppm的施用率下显示出100%的功效:I-1、I-2、I-10

[1017] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100ppm的施用率下显示出90%的功效:I-4

[1018] 家蝇试验

[1019] 溶剂:二甲基亚砷

[1020] 为了制备合适的活性化合物制剂,将10mg活性化合物与0.5mL二甲基亚砷混合,并用水将该浓液稀释至所需浓度。

[1021] 在含有用糖溶液和所需浓度的活性化合物制剂处理的海绵的容器中,放入10只成年家蝇 (*Musca domestica*)。

[1022] 2天后,测定以%计的杀死率。100%意指所有蝇都已被杀死;0%意指没有蝇被杀死。

[1023] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100ppm的施用率下显示出85%的功效:I-12

[1024] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100ppm的施用率下显示出80%的功效:I-7、I-10、I-18

[1025] 桃蚜——口服试验

[1026] 溶剂:100重量份的丙酮

[1027] 为了制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物用所述重量份的溶剂溶解,并用水补足至所需浓度。

[1028] 将50 μ L活性化合物制剂转移到微量滴定板中,并用150 μ L IPL41昆虫培养基 (33%+15%糖) 补足至200 μ L的最终体积。随后,用石蜡膜密封所述板,在第二微量滴定板中的桃蚜 (*Myzus persicae*) 的混合种群能刺穿石蜡膜并吸食溶液。

[1029] 5天后,测定以%计的功效。100%意指所有桃蚜都已被杀死;0%意指没有桃蚜被杀死。

[1030] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在0.8ppm的施用率下显示出100%的功效:I-19

[1031] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在4ppm的施用率下显示出100%的功效:I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-8、I-9、I-12、I-15、I-16、I-18、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-25

[1032] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在4ppm的施用率下显示出90%的功效:I-10、I-11、I-13、I-14

[1033] 桃蚜——喷洒试验

[1034] 溶剂:78重量份的丙酮

[1035] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[1036] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[1037] 为了制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物用指定重量份的溶剂溶解,并用含有浓度为1000ppm的乳化剂的水补足至所需浓度。为了制备其他试验浓度,将制剂用含有乳化剂的水稀释。

[1038] 向感染所有阶段的桃蚜(*Myzus persicae*)的大白菜(*Brassica pekinensis*)的叶盘上喷洒所需浓度的活性化合物制剂。

[1039] 5天后,测定以%计的功效。100%意指所有的蚜虫都已被杀死;0%意指没有蚜虫被杀死。

[1040] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100g/ha的施用率下显示出100%的功效:I-7、I-12、I-18

[1041] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100g/ha的施用率下显示出90%的功效:I-6、I-11、I-14、I-15、I-16、I-21、I-22、I-24、I-25

[1042] 辣根猿叶甲——喷洒试验

[1043] 溶剂:78.0重量份的丙酮

[1044] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[1045] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[1046] 为了制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物用指定重量份的溶剂溶解,并用含有浓度为1000ppm的乳化剂的水补足至所需浓度。为了制备其他试验浓度,将制剂用含有乳化剂的水稀释。

[1047] 向大白菜(*Brassica pekinensis*)的叶盘上喷洒所需浓度的活性化合物制剂,并在干燥后,使芥菜甲虫(辣根猿叶甲)的幼虫栖居于叶盘上。

[1048] 7天后,测定以%计的功效。100%意指所有的甲虫幼虫都已被杀死;0%意指没有甲虫幼虫被杀死。

[1049] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100g/ha的施用率下显示出100%的功效:I-3、I-7、I-9、I-10、I-12、I-13、I-14、I-18、I-20、I-21

[1050] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100g/ha的施用率下显示出83%的功效:I-11

[1051] 草地贪夜蛾——喷洒试验

[1052] 溶剂:78.0重量份的丙酮

[1053] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[1054] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[1055] 为了制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物用指定重量份的溶剂溶解,并用含有浓度为1000ppm的乳化剂的水补足至所需浓度。为了制备其他试验浓度,将制剂用含有乳化剂的水稀释。

[1056] 向玉米 (*Zea mays*) 的叶盘上喷洒所需浓度的活性化合物制剂,并在干燥后,使秋叶蛾(草地贪夜蛾)的毛虫栖居于叶盘上。

[1057] 7天后,测定以%计的功效。100%意指所有的毛虫都已被杀死;0%意指没有毛虫被杀死。

[1058] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100g/ha的施用率下显示出100%的功效:I-3、I-7、I-8、I-9、I-10、I-12、I-13、I-14、I-16、I-18、I-20、I-21、I-23、I-25

[1059] 二斑叶螨——喷洒试验,OP-抗性

[1060] 溶剂:78.0重量份的丙酮

[1061] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[1062] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[1063] 为了制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物用指定重量份的溶剂溶解,并用含有浓度为1000ppm的乳化剂的水补足至所需浓度。为了制备其他试验浓度,将制剂用含有乳化剂的水稀释。

[1064] 向感染所有阶段的温室红叶螨(二斑叶螨)的菜豆 (*Phaseolus vulgaris*) 的叶盘上喷洒所需浓度的活性化合物制剂。

[1065] 6天后,测定以%计的功效。100%意指所有叶螨都已被杀死;0%意指没有叶螨被杀死。

[1066] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100g/ha的施用率下显示出90%的功效:I-7、I-12、I-15、I-30。