



(12)发明专利

(10)授权公告号 CN 106232579 B

(45)授权公告日 2018.11.23

(21)申请号 201580019982.1

(22)申请日 2015.02.13

(65)同一申请的已公布的文献号  
申请公布号 CN 106232579 A

(43)申请公布日 2016.12.14

(30)优先权数据  
14155320.6 2014.02.17 EP

(85)PCT国际申请进入国家阶段日  
2016.10.14

(86)PCT国际申请的申请数据  
PCT/EP2015/053065 2015.02.13

(87)PCT国际申请的公布数据  
W02015/121406 DE 2015.08.20

(73)专利权人 拜耳作物科学股份公司  
地址 德国莱茵河畔蒙海姆

(72)发明人 M·海尔 E·K·海尔曼  
W·哈伦巴赫 K·伊尔格  
U·戈尔恩斯

(74)专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司 11285  
代理人 钟守期 谢小寒

(51)Int.Cl.  
C07D 209/42(2006.01)  
A01N 43/38(2006.01)

(56)对比文件  
CN 103502216 A,2014.01.08,  
WO 2004056768 A2,2004.07.08,  
CN 101160051 A,2008.04.09,  
CN 102741222 A,2012.10.17,  
审查员 王沙沙

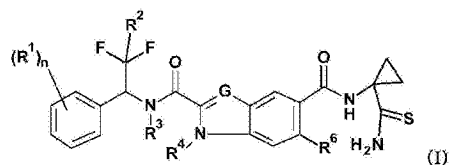
权利要求书1页 说明书64页

(54)发明名称

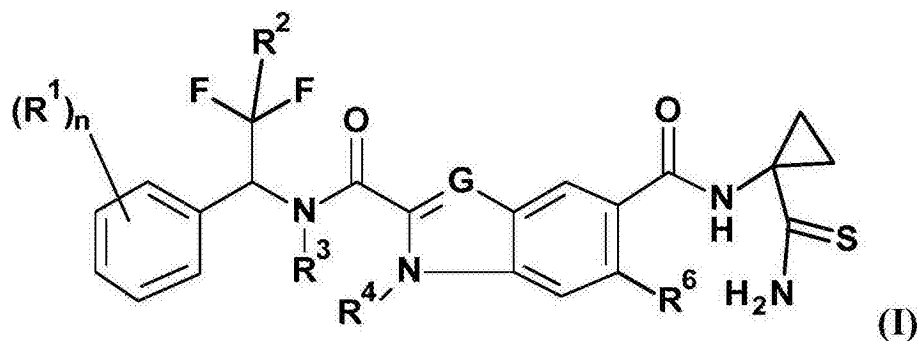
作为杀昆虫剂和杀螨剂的吡啶甲酰胺和苯并咪唑甲酰胺

(57)摘要

本发明涉及通式(I)的化合物,其中R1至R6、G和n具有说明书中给出的含义,以及涉及其制备方法和其作为杀昆虫剂和杀螨剂的用途。



1. 通式 (I) 的化合物, 以及式 (I) 的化合物的盐,



其中

$R^1$ 代表氟、氯、溴、碘或三氟甲基,

其中至少一个取代基 $R^1$ 代表氟、氯、溴或碘,

$R^2$ 代表氟或氢,

$n$ 代表2、3或4,

$R^3$ 代表氢,

$R^4$ 代表氢、甲基、乙基或丙-2-炔-1-基,

$G$ 代表CH,

$R^6$ 代表氯、溴、甲基或三氟甲基。

2. 权利要求1的通式 (I) 的化合物, 以及式 (I) 的化合物的盐, 其中

$R^1$ 代表氟、氯、溴或三氟甲基,

其中至少一个取代基 $R^1$ 代表氟或氯, 以及

$n$ 代表2、3或4。

3. 权利要求1或2的通式 (I) 的化合物, 以及式 (I) 的化合物的盐, 其中

$R^6$ 代表氯或甲基。

4. 农用化学品制剂, 其包含0.00000001重量%至98重量%的生物有效量的权利要求1至3中任一项的通式 (I) 的化合物和/或其盐, 基于所述农用化学品制剂的重量计, 以及还包含增量剂和/或表面活性剂。

5. 权利要求4的农用化学品制剂, 其还包含其他的农用化学活性化合物。

6. 用于防治动物有害物的方法, 其包括将权利要求1至3中任一项的通式 (I) 的化合物和/或其盐作用于动物有害物和/或其生境, 不包括用于治疗人体或动物体的方法。

7. 权利要求1至3中任一项的通式 (I) 的化合物用于保护植物的繁殖材料的用途。

## 作为杀昆虫剂和杀螨剂的吡啶甲酰胺和苯并咪唑甲酰胺

[0001] 本发明涉及新的农药,涉及制备其的方法,以及涉及其作为活性化合物的用途,特别涉及其作为杀昆虫剂和杀螨剂的用途。

[0002] 吡啶-2-甲酰胺和苯并咪唑-2-甲酰胺以及它们作为药物的用途已记载于文献中,参见,例如,WO-A-2010/126164、WO-A-2010/054138、US2009/0041722、WO-A-2007/115938、EP1460064、WO-A-2004-A-056768、WO-A-2004/032921、WO-A-20010/32622。WO-A-2012/119984公开了吡啶-2-甲酰胺和苯并咪唑-2-甲酰胺以及它们作为作物保护剂的用途。在该出版物中,实施例273公开了在六元吡啶环上具有氨基硫代羰基环丙基取代的酰胺基团的化合物。然而,该化合物在苯环上仅被三氟甲基单取代。

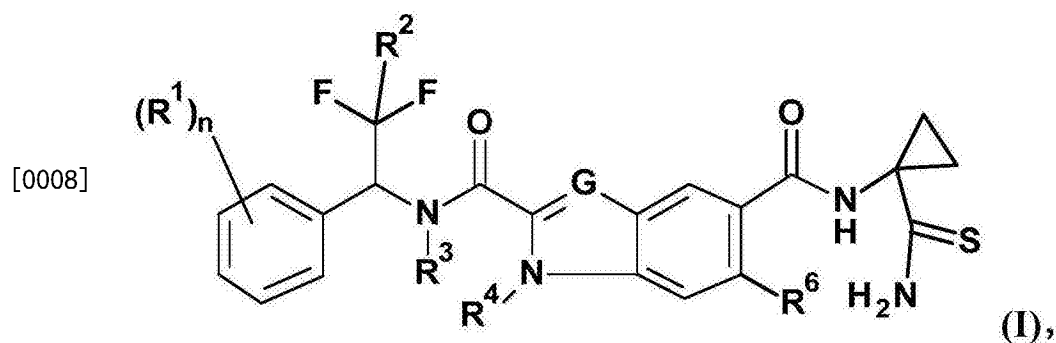
[0003] 出人意料地,现已发现,某些新的吡啶甲酰胺和苯并咪唑甲酰胺具有强的杀昆虫特性和杀螨特性且同时植物耐受性良好,具有有利的温血动物毒性和良好的环境相容性。本发明的新化合物迄今为止尚未被公开。

[0004] 现代作物保护组合物必须满足许多要求,例如,与它们作用的功效、持久性和作用谱以及可能的用途相关的要求。毒性问题以及与其他活性化合物或制剂助剂结合性的问题很关键,同样合成活性化合物所需费用的问题也很关键。此外,还可出现抗性。基于所有这些原因,对于新的作物保护剂的研究永远不能认为完成,并且不断需要相对于已知化合物至少在个别方面具有改进性质的新的化合物。

[0005] 本发明的目的在于提供在各个方面拓宽农药作用谱和/或提高农药活性的化合物。

[0006] 式(I)的新化合物的区别之处尤其在于在六元吡啶环上具有氨基硫代羰基环丙基取代的酰胺基团,以及苯环被多取代,其中这些取代基中的至少一个是卤素。出人意料的是,这些特征的结合产生改进的生物功效。这呈现在示出的生物用途实例中。

[0007] 因此,本发明提供了通式(I)的化合物以及式(I)的化合物的盐和N-氧化物,以及它们用于防治动物有害物的用途,



[0009] 其中

[0010] R<sup>1</sup>代表氰基、氟、氯、溴、碘、二氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、三氟甲基、五氟乙基、氯四氟乙基、二氟甲氧基、三氟甲氧基,

[0011] 其中至少一个取代基R<sup>1</sup>代表氟、氯、溴或碘,

[0012] R<sup>2</sup>代表氟、三氟甲基或氢,

[0013] n代表2、3、4或5,

- [0014] R<sup>3</sup>代表氢，
- [0015] R<sup>4</sup>代表氢、甲基、乙基、丙-1-基、丙-2-烯-1-基、丙-2-炔-1-基、乙烯基、丁-2-炔-1-基，
- [0016] G代表CH或N，
- [0017] R<sup>6</sup>代表氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基或三氟甲基。
- [0018] 在本发明的一个优选的实施方案(2-1)中，
- [0019] R<sup>1</sup>代表氟、氯、溴、碘或三氟甲基，
- [0020] 其中至少一个取代基R<sup>1</sup>代表氟、氯、溴或碘，
- [0021] R<sup>2</sup>代表氟或氢，
- [0022] n代表2、3或4，
- [0023] R<sup>3</sup>代表氢，
- [0024] R<sup>4</sup>代表氢、甲基、乙基或丙-2-炔-1-基，
- [0025] G代表CH或N，
- [0026] R<sup>6</sup>代表氯、溴、甲基或三氟甲基，
- [0027] 以及式(I)的化合物的盐和N-氧化物以及它们用于防治动物有害物的用途。
- [0028] 在一个特别优选的实施方案(3-1)中，R<sup>1</sup>代表氟、氯、溴或三氟甲基，且n代表2、3或4，其中至少一个取代基R<sup>1</sup>代表氟或氯，且所有其他基团、原子团和取代基均具有上述提到的对于优选实施方案(2-1)的含义。
- [0029] 在另一个特别优选的实施方案(3-2)中，R<sup>6</sup>代表氯或甲基，其中所有其他基团、原子团和取代基均具有上述提到的对于优选实施方案(2-1)的含义或上述提到的对于特别优选的实施方案(3-1)的含义。
- [0030] 在另一个特别优选的实施方案(3-3)中，G代表CH，其中所有其他基团、原子团和取代基均具有上述提到的对于优选实施方案(2-1)的含义或上述提到的对于特别优选的实施方案(3-1)的含义或上述提到的对于特别优选的实施方案(3-2)的含义。
- [0031] 在另一个特别优选的实施方案(3-4)中，G代表N，其中所有其他基团、原子团和取代基均具有上述提到的对于优选实施方案(2-1)的含义或上述提到的对于特别优选的实施方案(3-1)的含义或上述提到的对于特别优选的实施方案(3-2)的含义。
- [0032] 根据本发明，式(I)的化合物可被相同或不同的取代基R<sup>1</sup>所取代。
- [0033] 如果合适的话，式(I)的化合物可以以多种多晶型形式存在或以多种多晶型形式的混合物存在。纯多晶型物和多晶型物混合物均构成本发明主题的一部分，并且均可根据本发明进行使用。
- [0034] 式(I)的化合物包括存在的任何E/Z异构体和非对映异构体或对映异构体。
- [0035] 取代的吡啶甲酰胺和苯并咪唑甲酰胺一般由式(I)确定。对于上文和下文所指定的式的优选的基团定义如下。这些定义适用于式(I)的终产物，且同样适用于所有中间体。
- [0036] 式(I)中的取代基的特定数目n仅包括除氢以外的取代基。为此，氢也未包括在R<sup>1</sup>的定义中。当然，当在所讨论的位置上不存在R<sup>1</sup>取代基时，氢总是作为取代基存在。
- [0037] 在优选的定义中，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。
- [0038] 在特别优选的定义中，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。

[0039] 卤素取代的基团,例如卤代烷基,为单卤代或多卤代至取代基的最大可能数目。在多卤代的情况下,卤原子可以是相同的或不同的。为此,卤素是氟、氯、溴或碘,尤其是氟、氯或溴。

[0040] 饱和烃基或不饱和烃基(例如烷基、烯基或炔基)可各自为直链或可能范围内的支链,包括与杂原子结合,例如,以烷氧基的形式。

[0041] 任选取代的基团可以是单取代或多取代的,其中在多取代的情况下,取代基可以是相同的或不同的。

[0042] 上述的基团的一般意义或优选范围内的定义或说明适用于终产物并相应地适用于起始原料和中间体。这些基团定义可以按需要彼此结合,即包括各自优选范围之间的组合。

[0043] 本发明优选的是其中存在以上所列的优选的含意的结合的式(I)的化合物。

[0044] 本发明特别优选的是其中存在以上所列的特别优选的含意的结合的式(I)的化合物。

[0045] 同样优选的本发明的化合物是表1中所示的通式(I)的化合物。

[0046] 通式(I)的本发明的化合物可以任选地具有手性碳原子。

[0047] 根据Cahn、Ingold和Prelog规则(CIP规则),这些取代基可具有(R)构型或(S)构型。

[0048] 本发明包括在特定的手性碳原子上具有(S)和(R)两种构型的通式(I)的化合物,即,本发明包括其中所讨论的碳原子各自独立地具有以下构型的通式(I)的化合物:

[0049] (1) (R)构型;或

[0050] (2) (S)构型。

[0051] 当通式(I)的化合物中存在多于一个手性中心时,手性中心构型的任何期望的组合均是可能的,这意味着:

[0052] (1) 一个手性中心可以具有(R)构型而另一个手性中心具有(S)构型;

[0053] (2) 一个手性中心可以具有(R)构型而另一个手性中心具有(R)构型;和

[0054] (3) 一个手性中心可以具有(S)构型而另一个手性中心具有(S)构型。

[0055] 式(I)的化合物还包括存在的任何非对映异构体或对映异构体和E/Z异构体,以及式(I)的化合物的盐和N-氧化物,以及它们用于防治动物有害物的用途。

[0056] 本发明还涉及本发明的通式(I)的化合物用于制备农药的用途。

[0057] 异构体

[0058] 根据取代基的性质,式(I)的化合物可以以几何和/或光学活性异构体或不同组成的相应异构体混合物的形式存在。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以及这些异构体的任意所需的混合物。

[0059] 方法和用途

[0060] 本发明还涉及用于防治动物有害物的方法,其中式(I)的化合物可以作用于动物有害物和/或其生境。所述动物有害物的防治优选在农业和林业中、以及在材料保护中进行。从其中优选排除的方法是用于人体或动物体的外科治疗和治疗学上处理的方法以及在

人体或动物体上实施的诊断方法。

[0061] 本发明还涉及式(I)的化合物用作农药的用途,尤其是用作作物保护剂的用途。

[0062] 在本申请的上下文中,术语“农药”通常还包括术语“作物保护剂”。

[0063] 具有良好的植物耐受性、有利的恒温动物毒性和良好的环境相容性的式(I)的化合物适于下述用途:保护植物和植物器官抵抗生物和非生物胁迫因素、提高采收产率、提高采收材料的品质,以及防治在农业、园艺业、畜牧业、水产养殖业、林业、园林和休闲设施、储存产品和材料的保护以及卫生领域中遇到的动物有害物,尤其是昆虫、蛛形纲、蠕虫、线虫和软体动物。其可优选用作农药。它们能有效抵抗通常敏感和抗性的物种,以及抵抗所有或某些发育阶段。上述有害物包括:

[0064] 节肢动物门(Arthropoda)、尤其是蛛形纲(Arachnida)的有害物,例如粉螨属(例如粗脚粉螨(*Acarus siro*)、枸杞瘤瘿螨(*Aceria kuko*)、柑橘瘤瘿螨(*Aceria sheldoni*))、刺皮瘿螨属(*Aculops* spp.)、针刺瘿螨属(*Aculus* spp.) (例如佛氏刺瘿螨(*Aculus fockeui*)、苹果刺瘿螨(*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*))、蚜苔螨(*Bryobiagraminum*)、苜蓿苔螨(*Bryobia praetiosa*)、刺尾蝎属(*Centruroides* spp.)、皮螨属(*Chorioptes* spp.)、鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*)、欧洲屋尘螨(*Dermatophagoides pteronyssinus*)、美洲屋尘螨(*Dermatophagoides farinae*)、革蜱属(*Dermacentor* spp.)、始叶螨属(*Eotetranychus* spp.) (例如核桃始叶螨(*Eotetranychus hicoriae*))、梨上瘿螨(*Epitrimerus pyri*)、真叶螨属(*Eutetranychus* spp.) (例如班氏真叶螨(*Eutetranychus banksi*))、瘿螨属(*Eriophyes* spp.) (例如梨瘿螨(*Eriophyes pyri*))、家甜食螨(*Glycyphagus domesticus*)、红足海镰螯螨(*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.)、毒蛛属(*Latrodectus* spp.)、斜蛛属(*Loxosceles* spp.)、秋收恙螨(*Neutrombicula autumnalis*)、*Nuphresa* spp.、小爪螨属(*Oligonychus* spp.) (例如*Oligonychus coniferarum*、冬青小爪螨(*Oligonychus ilicis*)、甘蔗小爪螨(*Oligonychus indicus*)、芒果小爪螨(*Oligonychus mangiferus*)、草地小爪螨(*Oligonychus pratensis*)、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.) (例如柑桔全爪螨(*Panonychus citri*) (=Metatetranychus citri))、苹果全爪螨(*Panonychus ulmi*) (=Metatetranychus ulmi)))、柑桔锈螨(*Phyllocoptruta oleivora*)、多趾宽叶螨(*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*)、狭跗线螨种(*Stenotarsonemus* spp.)、稻细螨(*Steneotarsonemus spinki*)、跗线螨属(*Tarsonemus* spp.) (例如乱跗线螨(*Tarsonemus confusus*)、樱草狭跗线螨(*Tarsonemus pallidus*))、叶螨属(*Tetranychus* spp.) (例如加拿大叶螨(*Tetranychus canadensis*)、朱砂叶螨(*Tetranychus cinnabarinus*)、土耳其斯坦叶螨(*Tetranychus 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*)；

[0065] 唇足纲(*Chilopoda*)的有害物,例如,地蜈蚣属(*Geophilus* spp.)、蚰蜒属(*Scutigera* spp.)；

[0066] 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*)；

[0067] 倍足纲(*Diplopoda*)的有害物,例如,千足虫(*Blaniulus guttulatus*)；

[0068] 昆虫纲的有害物,例如蜚蠊目(*Blattodea*),如东方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、亚洲蜚蠊(*Blattella asahinai*)、德国小蠊(*Blattella germanica*)、马德拉蜚蠊(*Leucophaea maderae*)、古巴蠊属(*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*))、棕带蜚蠊(*Supella longipalpa*)；

[0069] 鞘翅目(*Coleoptera*)的有害物,例如,条纹南瓜甲(*Acalymma vittatum*)、菜豆象(*Acanthoscelides obtectus*)、喙丽金龟属(*Adoretus* spp.)、杨树萤叶甲(*Agelastica alni*)、叩甲属(*Agriotes* spp.) (例如直条叩头虫(*Agriotes linneatus*)、小麦叩头虫(*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.)、花象属(*Anthonomus* spp.) (例如棉铃象甲(*Anthonomus grandis*))、圆皮蠹属(*Anthrenus* spp.)、梨象属(*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*))、龟叶甲属(*Cassida* spp.)、菜豆莖叶甲(*Cerotoma trifurcata*)、龟象属(*Ceuthorrhynchus* spp.) (例如白菜籽龟象(*Ceuthorrhynchus assimilis*)、甘蓝茎龟象(*Ceuthorrhynchus quadridens*)、白菜龟象(*Ceuthorrhynchus rapae*))、跳甲属(*Chaetocnema* spp.) (例如甘薯跳甲(*Chaetocnema confinis*)、美国齿跳甲(*Chaetocnema denticulata*)、荒地玉米跳甲(*Chaetocnema ectypa*))、*Cleonus mendicus*、宽胸叩头虫属(*Conoderus* spp.)、根颈象属(*Cosmopolites* spp.) (例如香蕉根颈象甲(*Cosmopolites sordidus*))、褐新西兰肋翅鳃角金龟(*Costelytra zealandica*)、叩甲属(*Ctenicera* spp.)、象虫属(*Curculio* spp.) (例如美核桃象(*Curculio caryae*)、大栗象(*Curculio caryatrypes*)、美洲榛子象(*Curculio obtusus*)、小栗象(*Curculio sayi*))、锈赤扁谷盗(*Cryptolestes ferrugineus*)、长角扁谷盗(*Cryptolestes pusillus*)、杨干隐喙(*Cryptorhynchus lapathi*)、芒果果核象甲(*Cryptorhynchus mangiferae*)、细枝象属(*Cylindrocopturus* spp.)、密点细枝象(*Cylindrocopturus adpersus*)、洋松细枝象(*Cylindrocopturus furnissi*)、皮蠹属(*Dermestes* spp.)、叶甲属(*Diabrotica* spp.) (例如带斑黄瓜条叶甲(*Diabrotica balteata*)、北方玉米根叶甲(*Diabrotica barberi*)、南方十一星瓜叶甲(*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、南方十一星瓜叶甲亚种(*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*)、西方玉米根叶甲(*Diabrotica virgifera virgifera*)、墨西哥玉米根叶甲(*Diabrotica virgifera zea*))、蛀野螟属(*Dichocrocis* spp.)、水稻铁甲(*Dicladispa armigera*)、*Diloboderus* spp.、食植瓢虫属

(*Epilachna* spp.) (例如瓜食植瓢虫 (*Epilachna borealis*)、墨西哥豆瓢虫 (*Epilachna varivestis*))、毛跳甲属 (*Epitrix* spp.) (例如黄瓜跳甲 (*Epitrix cucumeris*)、茄子跳甲 (*Epitrix fuscula*)、烟草跳甲 (*Epitrix hirtipennis*)、美国马铃薯跳甲 (*Epitrix subcrinita*)、块茎跳甲 (*Epitrix tuberis*))、钻孔虫属 (*Faustinus* spp.)、裸蛛甲 (*Gibbium psylloides*)、阔角谷盗 (*Gnathocerus cornutus*)、菜心野螟 (*Hellula undalis*)、黑异爪蔗金龟 (*Heteronychus arator*)、寡节鳃金龟属 (*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*)、毛竹小蠹 (*Hypothenemus pubescens*))、甘蔗大褐齿爪鳃金龟 (*Lachnosterna consanguinea*)、烟草甲 (*Lasioderma serricorne*)、长头谷盗 (*Latheticus oryzae*)、波缘薪甲属 (*Lathridius* spp.)、负泥虫属 (*Lema* spp.)、马铃薯甲虫 (*Leptinotarsa decemlineata*)、潜叶蛾属 (*Leucoptera* spp.) (例如咖啡潜叶蛾 (*Leucoptera coffeella*))、稻根象 (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、筒喙象属 (*Lixus* spp.)、黄胸寡毛跳甲 (*Luperomorpha xanthodera*)、萤叶甲属 (*Luperodes* spp.)、粉蠹属 (*Lyctus* spp.)、美洲叶甲属 (*Megascelis* spp.)、梳爪叩头虫属 (*Melanotus* spp.) (例如 *Melanotus longulus oregonensis*)、油菜花露尾甲 (*Meligethes aeneus*)、鳃金龟属 (*Melolontha* spp.) (例如欧洲鳃金龟 (*Melolontha melolontha*))、*Migdolus* spp.、墨天牛属 (*Monochamus* spp.)、象甲 (*Naupactus xanthographus*)、隐跗郭公虫属 (*Necrobia* spp.)、黄蛛甲 (*Niptus hololeucus*)、椰蛀犀金龟 (*Oryctes rhinoceros*)、锯谷盗 (*Oryzaeophilus surinamensis*)、*Oryzaphagus oryzae*、耳喙象属 (*Otiorhynchus* spp.) (例如苹果耳喙象 (*Otiorhynchus cribricollis*)、苜蓿耳喙象 (*Otiorhynchus ligustici*)、草莓耳喙象 (*Otiorhynchus ovatus*)、粗糙草莓耳喙象 (*Otiorhynchus rugosostriatus*)、黑葡萄耳喙象 (*Otiorhynchus sulcatus*))、小青花金龟 (*Oxycetonia jucunda*)、辣根猿叶虫 (*Phaedon cochleariae*)、食叶鳃金龟属 (*Phyllophaga* spp.)、鳃金龟 (*Phyllophaga helleri*)、黄条跳甲属 (*Phyllotreta* spp.) (例如辣根条跳甲 (*Phyllotreta armoraciae*)、西方黑跳甲 (*Phyllotreta pusilla*)、美条纹跳甲 (*Phyllotreta ramosa*)、黄曲条跳甲 (*Phyllotreta striolata*)、日本弧丽金龟 (*Popillia japonica*)、象甲属 (*Premnotrypes* spp.)、大谷蠹 (*Prostephanus truncatus*)、跳甲属 (*Psylliodes* spp.) (例如马铃薯跳甲 (*Psylliodes affinis*)、油菜兰跳甲 (*Psylliodes chrysocephala*)、忽布跳甲 (*Psylliodes punctulata*))、蛛甲属 (*Ptinus* spp.)、暗色瓢虫 (*Rhizobius ventralis*)、谷蠹 (*Rhizopertha dominica*)、谷象属 (*Sitophilus* spp.) (例如谷象 (*Sitophilus granarius*)、罗望子象 (*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*))、宽幅天牛属 (*Symphyletes* spp.)、纤毛象属 (*Tanymecus* spp.) (例如双宽隆突纤毛象 (*Tanymecus dilaticollis*)、印度纤毛象 (*Tanymecus indicus*)、红豆草灰象甲 (*Tanymecus palliatus*))、黄粉虫 (*Tenebrio molitor*)、大谷盗 (*Tenebrioides mauretanicus*)、拟谷盗属 (*Tribolium* spp.) (例如美洲黑拟谷盗 (*Tribolium audax*)、赤拟谷盗 (*Tribolium castaneum*)、杂拟谷盗 (*Tribolium confusum*))、斑皮蠹属 (*Trogoderma*



spp.)、籽象属(*Tychius* spp.)、脊虎天牛属(*Xylotrechus* spp.)、距步甲属(*Zabrus* spp.) (例如玉米距步甲(*Zabrus tenebrioides*));

[0070] 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*)、骚扰伊蚊(*Aedes vexans*))、潜蝇属(*Agromyza* spp.) (例如苜蓿斑潜蝇(*Agromyza frontella*)、美洲黍潜蝇(*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*)、东方果实蝇(*Bactrocera dorsalis*)、油橄榄果实蝇(*Bactrocera oleae*))、花园毛蚊(*Bibio hortulanus*)、天青丽蝇(*Calliphora erythrocephala*)、红头丽蝇(*Calliphora vicina*)、地中海实蝇(*Ceratitis capitata*)、摇蚊属(*Chironomus* spp.)、金蝇属(*Chrysomyia* spp.)、斑虻属(*Chrysops* spp.)、高额麻虻(*Chrysozona pluvialis*)、锥蝇属(*Cochliomyia* spp.)、康瘿蚊属(*Contarinia* spp.) (例如葡萄瘿蚊(*Contarinia johnsoni*)、甘蓝瘿蚊(*Contarinia nasturtii*)、梨实康瘿蚊(*Contarinia pyrivora*)、向日葵瘿蚊(*Contarinia schulzi*)、高粱康瘿蚊(*Contarinia sorghicola*)、麦黄康瘿蚊(*Contarinia tritici*))、人皮蝇(*Cordylobia anthropophaga*)、环足摇蚊(*Cricotopus sylvestris*)、库蚊属(*Culex* spp.) (例如尖音库蚊(*Culex pipiens*)、致乏库蚊(*Culex quinquefasciatus*))、库蠓属(*Culicoides* spp.)、脉毛蚊属(*Culiseta* spp.)、黄蝇属(*Cuterebra* spp.)、橄榄大实蝇(*Dacus oleae*)、叶瘿蚊属(*Dasyneura* spp.) (例如油菜叶瘿蚊(*Dasyneura brassicae*))、地种蝇属(*Delia* spp.) (例如葱蝇(*Delia antiqua*)、麦种蝇(*Delia coarctata*)、毛跗地种蝇(*Delia florilega*)、灰地种蝇(*Delia platura*)、甘蓝地种蝇(*Delia radicum*))、人肤蝇(*Dermatobia hominis*)、果蝇属(*Drosophila* spp.) (例如黑腹果蝇(*Drosophila melanogaster*)、樱桃果蝇(*Drosophila suzukii*))、稻象属(*Echinocnemus* spp.)、厕蝇属(*Fannia* spp.)、胃蝇属(*Gastrophilus* spp.)、舌蝇属(*Glossina* spp.)、麻虻属(*Haematopota* spp.)、毛眼水蝇属(*Hydrellia* spp.)、大麦毛眼水蝇(*Hydrellia griseola*)、黑蝇属(*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.)、瑞典麦秆蝇(*Oscinella frit*)、拟长跑摇蚊属(*Paratanytarsus* spp.)、*Paralauterborniella subcineta*、泉蝇属(*Pegomya* spp.) (例如甜菜泉蝇(*Pegomya betae*)、天仙子泉蝇(*Pegomya hyoscyami*)、悬钩子泉蝇(*Pegomya rubivora*))、白蛉属(*Phlebotomus* spp.)、草种蝇属(*Phorbia* spp.)、伏蝇属(*Phormia* spp.)、酪蝇(*Piophilus casei*)、*Prodiplosis* spp.、胡萝卜茎蝇(*Psila rosae*)、绕实蝇属(*Rhagoletis* spp.) (例如东部樱桃实蝇(*Rhagoletis cingulata*)、核桃绕实蝇(*Rhagoletis completa*)、黑樱桃实蝇(*Rhagoletis fausta*)、西部樱桃实蝇(*Rhagoletis indifferens*)、越桔实蝇(*Rhagoletis mendax*)、苹果实蝇(*Rhagoletis pomonella*))、麻蝇属(*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*));

[0071] 半翅目(Hemiptera)的有害物,例如*Acizzia acaciaebaileyanae*、*Acizzia dodonaeae*、木虱(*Acizzia uncatoides*)、长头蝗(*Acrida turrita*)、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(*Agonosцена* spp.)、欧洲甘蓝粉虱(*Aleyrodes proletella*)、蔗粉穴粉虱(*Aleurolobus barodensis*)、棉粉虱(*Aleurothrixus floccosus*)、植莲木虱(*Allocaridara malayensis*)、芒果叶蝉属(*Amrasca* spp.) (例如小绿叶蝉(*Amrasca bigutulla*)、小叶蝉(*Amrasca devastans*))、圆尾蚜(*Anuraphis cardui*)、肾圆盾蚧属(*Aonidiella* spp.) (例如红肾圆盾蚧(*Aonidiella aurantii*)、黄肾圆盾蚧(*Aonidiella citrina*)、苏铁肾盾蚧(*Aonidiella inornata*))、梨瘤蚜(*Aphanostigma piri*)、蚜属(*Aphis* spp) (例如绣线菊蚜(*Aphis citricola*)、黑豆蚜(*Aphis craccivora*)、甜菜蚜(*Aphis fabae*)、草莓根蚜(*Aphis forbesi*)、大豆蚜(*Aphis glycines*)、棉蚜(*Aphis gossypii*)、常春藤蚜(*Aphis hederæ*)、葡萄藤蚜(*Aphis illinoisensis*)、*Aphis middletoni*、鼠李马铃薯蚜(*Aphis nasturtii*)、夹竹桃蚜(*Aphis nerii*)、苹果蚜(*Aphis pomi*)、卷叶蚜(*Aphis spiræcola*)、*Aphis viburniphila*)、葡萄叶蜂(*Arboridia apicalis*)、*Arytainilla* spp.、小圆盾蚧属(*Aspidiella* spp.)、圆盾蚧属(*Aspidiotus* spp.) (例如常春藤圆盾蚧(*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 melaleucae*、李短尾蚜(*Brachycaudus helichrysi*)、微管姆属(*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*)、丽黄头大叶蝉(*Carneocephala fulgida*)、甘蔗绵蚜(*Ceratovacuna lanigera*)、沫蝉科(*Cercopidae*)、蜡蚧属(*Ceroplastes* spp.)、草莓钉蚜(*Chaetosiphon fragaefolii*)、蔗黄雪盾蚧(*Chionaspis tegalensis*)、茶绿叶蜂(*Chlorita onukii*)、台湾大蝗(*Chondracris rosea*)、核桃黑斑蚜(*Chromaphis juglandicola*)、黑褐圆盾蚧(*Chrysomphalus ficus*)、玉米叶蝉(*Cicadulina mbila*)、*Coccomytilus halli*、软蚧属(*Coccus* spp.) (例如褐软蚧(*Coccus hesperidum*)、长椭圆软蚧(*Coccus longulus*)、桔软蜡蚧(*Coccus pseudomagnoliarum*)、咖啡绿蚧(*Coccus viridis*))、隐瘤蚜(*Cryptomyzus ribis*)、*Cryptoneossa* spp.、梳木虱属(*Ctenarytaina* spp.)、黄翅叶蝶属(*Dalbulus* spp.)、柑橘粉虱(*Dialeurodes citri*)、柑橘木虱(*Diaphorina citri*)、白背盾蚧属(*Diaspis* spp.)、履绵蚧属(*Drosicha* spp.)、西圆尾蚜属(*Dysaphis* spp.) (例如锈条蚜(*Dysaphis apiifolia*)、车前草蚜(*Dysaphis plantaginea*)、百合西圆尾蚜(*Dysaphis tulipae*))、灰粉蚧属(*Dysmicoccus* spp.)、小绿叶蝉属(*Empoasca* spp.) (例如西部马铃薯叶蝉(*Empoasca abrupta*)、蚕豆小叶蝉(*Empoasca fabae*)、苹果小绿叶蝉(*Empoasca maligna*)、茄微叶蝉(*Empoasca solana*)、*Empoasca stevensi*)、绵蚜属(*Eriosoma* spp.) (例如美洲绵蚜(*Eriosoma americanum*)、苹果绵蚜(*Eriosoma lanigerum*)、梨根绵蚜(*Eriosoma pyricola*))、斑叶蝉属(*Erythroneura* spp.)、*Eucalyptolyma* spp.、褐木虱属(*Euphyllura* spp.)、殃叶蝉(*Euscelis bilobatus*)、拂粉阶属(*Ferrisia* spp.)、咖啡地粉蚧(*Geococcus*

coffae)、Glycaspis spp.、银合欢木虱(Heteropsylla cubana)、颊木虱(Heteropsylla spinulosa)、假桃病毒叶蝉(Homalodisca coagulata)、梅大尾蚜(Hyalopterus arundinis)、桃大尾蚜(Hyalopterus pruni)、吹绵蚧属(Icerya spp.) (例如吹绵蚧壳虫(Icerya purchasi))、Idiocerus spp.、扁喙叶蝉属(Idioscopus spp.)、灰飞虱(Laodelphax striatellus)、蜡蚧属(Lecanium spp.) (例如水土坚蚧(Lecanium corni) (=Parthenolecanium corni))、盾蚧属(Lepidosaphes spp.) (例如榆蚧盾蚧(Lepidosaphes ulmi))、萝卜蚜(Lipaphis erysimi)、斑衣蜡蝉(Lycorma delicatula)、长管蚜属(Macrosiphum spp.) (例如马铃薯长管蚜(Macrosiphum euphorbiae)、百合长管蚜(Macrosiphum lilii)、蔷薇长管蚜(Macrosiphum rosae))、二点叶蜂(Macrosteles facifrons)、沫蝶属(Mahanarva spp.)、高粱蚜(Melanaphis sacchari)、Metcalfiella spp.、Metcalfa pruinosa、麦无网蚜(Metopolophium dirhodum)、黑缘平翅斑蚜(Monellia costalis)、Monelliopsis pecanis、瘤蚜属(Myzus spp.) (例如冬葱瘤蚜(Myzus ascalonicus)、梅瘤蚜(Myzus cerasi)、女贞瘤蚜(Myzus ligustri)、莖菜瘤蚜(Myzus ornatus)、桃蚜(Myzus persicae)、烟蚜(Myzus nicotianae))、莴苣衲长管蚜(Nasonovia ribisnigri)、黑尾叶蝉属(Nephotettix spp.) (例如黑尾叶蝉(Nephotettix cincticeps)、二条黑尾叶蝉(Nephotettix nigropictus))、褐飞虱(Nilaparvata lugens)、Oncometopia spp.、Orthezia praelonga、中华稻蝗(Oxya chinensis)、Pachypsylla spp.、杨梅粉虱(Parabemisia myricae)、虱啮属(Paratrioza spp.) (例如马铃薯木虱(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)、绵粉蚧属(Phenacoccus spp.) (例如美地绵粉蚧(Phenacoccus madeirensis))、杨平翅绵蚜(Phloeomyzus passerinii)、忽布疣蚜(Phorodon humuli)、葡萄根瘤蚜属(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.) (例如橘臀纹粉蚧(Planococcus citri))、Prosopidopsylla flava、梨形原绵腊蚧(Protopulvinaria pyriformis)、桑白盾蚧(Pseudaulacaspis pentagona)、粉蚧属(Pseudococcus spp.) (例如柑栖粉蚧(Pseudococcus calceolariae)、康氏粉蚧(Pseudococcus comstocki)、拟长尾粉蚧(Pseudococcus longispinus)、葡萄粉蚧(Pseudococcus maritimus)、暗色粉蚧(Pseudococcus viburni))、Psyllopsis spp.、木虱属(Psylla spp.) (例如黄杨木虱(Psylla buxi)、苹木虱(Psylla mali)、梨木虱(Psylla pyri))、金小蜂属(Pteromalus spp.)、Pyrilla spp.、笠圆盾蚧属(Quadraspidotus spp.) (例如胡桃园盾蚧(Quadraspidotus juglansregiae)、杨笠圆盾蚧(Quadraspidotus ostreaeformis)、梨笠盾蚧(Quadraspidotus perniciosus))、Quesada gigas、平刺粉蚧属(Rastrococcus spp.)、缢管蚜属(Rhopalosiphum spp.) (例如玉米蚜(Rhopalosiphum maidis)、苹草缢管蚜(Rhopalosiphum oxyacanthae)、稻麦蚜(Rhopalosiphum padi)、红腹缢管蚜(Rhopalosiphum rufiabdominale))、黑盔蚧属(Saissetia spp.) (例如咖啡黑盔蚧(Saissetia coffeae)、Saissetia miranda、Saissetia neglecta、黑蜡蚧(Saissetia oleae))、葡萄带叶蝉(Scaphoideus titanus)、麦二叉蚜(Schizaphis graminum)、苏铁刺圆盾蚧(Selenaspidus articulatus)、麦长管蚜

(*Sitobion avenae*)、长唇基飞虱属(*Sogata* spp.)、白背飞虱(*Sogatella furcifera*)、稻飞虱属(*Sogatodes* spp.)、*Stictocephala festina*、树粉虱(*Siphoninus phillyreae*)、*Tenalaphara malayensis*、*Tetragonocephala* spp.、长斑蚜属(*Tinocallis caryaefoliae*)、广胸沫蝉属(*Tomaspis* spp.)、声蚜属(*Toxoptera* spp.) (例如小桔蚜(*Toxoptera aurantii*)、大桔蚜(*Toxoptera citricidus*))、温室粉虱(*Trialeurodes vaporariorum*)、尖翅木虱属(*Trioza* spp.) (例如柿木虱(*Trioza diospyri*))、小叶蝉属(*Typhlocyba* spp.)、尖盾蚧属(*Unaspis* spp.)、葡萄根瘤蚜(*Viteus vitifolii*)、么叶蝉属(*Zygina* spp.)；

[0072] 异翅目(Heteroptera)的有害物,例如,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.)、斑腿微刺盲蝽(*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*))、白瓣麦寄蝇属(*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.) (例如英雄美洲蝽(*Euschistus heros*)、褐美洲蝽(*Euschistus servus*)、三色美洲蝽(*Euschistus tristigma*)、三点美洲蝽(*Euschistus variolarius*))、扁盾蝽属(*Eurygaster* spp.)、茶翅蝽(*Halyomorpha halys*)、盲蝽属(*Heliopeltis* spp.)、*Horcias nobilellus*、稻缘蝽属(*Leptocorisa* spp.)、异稻缘蝽(*Leptocorisa varicornis*)、西部喙缘蝽(*Leptoglossus occidentalis*)、叶缘缘蝽(*Leptoglossus phyllopus*)、丽盲蝽属(*Lygocoris* spp.) (例如原丽盲蝽(*Lygocoris pabulinus*))、草盲蝽属(*Lygus* spp.) (例如灰豆草盲蝽(*Lygus elisus*)、豆荚草盲蝽(*Lygus hesperus*)、美国牧草盲蝽(*Lygus lineolaris*))、蔗黑长蝽(*Macropes excavatus*)、金光绿盲蝽(*Monalonion atratum*)、绿蝽属(*Nezara* spp.) (例如稻绿蝽(*Nezara viridula*))、稻蝽属(*Oebalus* spp.)、方背皮蝽(*Piesma quadrata*)、壁蝽属(*Piezodorus* spp.) (例如盖德拟壁蝽(*Piezodorus guildinii*))、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.)；

[0073] 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*))、美切叶蚁属(*Atta* 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*)、苹叶蜂(*Hoplocampa testudinea*))、毛蚁属(*Lasius* spp.)、小家蚁(*Monomorium pharaonis*)、树蜂属(*Sirex* spp.)、红火蚁(*Solenopsis invicta*)、臭蚁属(*Tapinoma* spp.)、大树蜂属(*Urocerus* spp.)、胡蜂属(*Vespa* spp.) (例如黄边胡蜂(*Vespa crabro*))、黑树蜂属(*Xeris* spp.)；

[0074] 等足目(Isopoda)的有害物,例如,鼠妇(*Armadillidium vulgare*)、栉水虱(*Oniscus asellus*)、球鼠妇(*Porcellio scaber*)；

[0075] 等翅目(Isoptera)的有害物,例如,家白蚁属(*Coptotermes* spp.) (例如台湾乳白蚁(*Coptotermes formosanus*))、堆角白蚁(*Cornitermes cumulans*)、堆砂白蚁属

(*Cryptoterme* spp.)、楹白蚁属(*Incisiterme* spp.)、稻麦小白蚁(*Microtermes obesi*)、土白蚁属(*Odontoterme* spp.)、散白蚁属(*Reticuliterme* spp.) (例如黄肢散白蚁(*Reticuliterme flavipes*)、美国散白蚁(*Reticuliterme hesperus*));

[0076] 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(*Argyroploce* spp.)、甘蓝夜蛾(*Barathra brassicae*)、粘弄蝶(*Borbo cinnara*)、棉潜蛾(*Bucculatrix thurberiella*)、松尺蠖(*Bupalus piniarius*)、蛀褐夜蛾属(*Busseola* spp.)、卷叶蛾属(*Cacoecia* spp.)、茶细蛾(*Caloptilia theivora*)、烟卷蛾(*Capua reticulana*)、苹果小卷蛾(*Carpocapsa pomonella*)、桃蛀果蛾(*Carposina niponensis*)、冬尺蛾(*Cheimatobia brumata*)、禾草螟属(*Chilo* spp.) (例如*Chilo plejadellus*、二化螟(*Chilo suppressalis*))、色卷蛾属(*Choristoneura* spp.)、葡萄果蠹蛾(*Clysia ambiguella*)、纵卷叶野螟属(*Cnaphalocerus* spp.)、稻纵卷叶野螟(*Cnaphalocrocis medinalis*)、云卷蛾属(*Cnephasia* spp.)、茶枝尖细蛾属(*Conopomorpha* spp.)、球颈象属(*Conotrachelus* spp.)、*Copitarsia* spp.、小卷蛾属(*Cydia* spp.) (例如豆荚小卷蛾(*Cydia nigricana*)、苹果蠹蛾(*Cydia pomonella*))、*Dalaca noctuides*、绢野螟属(*Diaphania* spp.)、小蔗秆草螟(*Diatraea saccharalis*)、钻夜蛾属(*Earias* spp.)、*Ecdytolopha aurantium*、南美玉米苗斑螟(*Elasmopalpus lignosellus*)、甘薯秆螟(*Eldana saccharina*)、粉斑螟属(*Ephestia* spp.) (例如烟草粉斑螟(*Ephestia elutella*)、地中海斑螟(*Ephestia kuehniella*))、叶小卷蛾属(*Epinotia* spp.)、苹淡褐卷蛾(*Epiphyas postvittana*)、荚斑螟属(*Etiella* spp.)、棕卷蛾属(*Eulia* spp.)、女贞细卷蛾(*Eupoecilia ambiguella*)、毒蛾属(*Euproctis* spp.) (例如黄毒蛾(*Euproctis chrysorrhoea*))、切夜蛾属(*Euxoa* spp.)、脏切夜蛾属(*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*))、甘蔗螟属(*Hedylepta* spp.)、铃夜蛾属(*Helicoverpa* spp.) (例如棉铃虫(*Helicoverpa armigera*)、玉米夜蛾(*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*)、柿举枝蛾(*Kakivoria flavofasciata*)、贪夜蛾属(*Laphygma* spp.)、茄白翅野螟(*Leucinodes orbonalis*)、纹潜蛾属(*Leucoptera* spp.) (例如咖啡潜叶蛾(*Leucoptera coffeella*))、潜叶细蛾属(*Lithocolletis* spp.) (例如苹果斑幕潜叶蛾(*Lithocolletis blancardella*))、绿果冬夜蛾(*Lithophane antennata*)、花翅小蛾属(*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.) (例如桃潜叶蛾(*Lyonetia clerkella*))、黄褐天幕毛虫(*Malacosoma neustria*)、豆荚野螟(*Maruca testulalis*)、甘

蓝夜蛾 (*Mamestra brassicae*)、稻暮眼蝶 (*Melanitis leda*)、毛胫夜蛾属 (*Mocis* spp.)、*Monopis obviella*、粘虫 (*Mythimna separata*)、橡长角蛾 (*Nemapogon cloacellus*)、水螟属 (*Nymphula* spp.)、*Oiketicus* spp.、麦秆夜蛾属 (*Oria* spp.)、瘤丛螟属 (*Orthaga* spp.)、秆野螟属 (*Ostrinia* spp.) (例如欧洲玉米螟 (*Ostrinia nubilalis*))、黑角负泥虫 (*Oulema melanopus*)、水稻负泥虫 (*Oulema oryzae*)、小眼夜蛾 (*Panolis flammea*)、稻弄蝶属 (*Parnara* spp.)、红铃虫属 (*Pectinophora* spp.) (例如棉红铃虫 (*Pectinophora gossypiella*))、潜跳甲属 (*Perileucoptera* spp.)、茄麦蛾属 (*Phthorimaea* spp.) (例如马铃薯麦蛾 (*Phthorimaea operculella*))、桔潜蛾 (*Phyllocnistis citrella*)、小潜细蛾属 (*Phyllonorycter* spp.) (例如金纹小潜细蛾 (*Phyllonorycter blancardella*))、山楂潜叶蛾 (*Phyllonorycter crataegella*)、粉蝶属 (*Pieris* spp.) (例如菜粉蝶 (*Pieris rapae*))、荷兰石竹小卷蛾 (*Platynota stultana*)、印度谷斑螟 (*Plodia interpunctella*)、金翅夜蛾属 (*Plusia* spp.)、菜蛾 (*Plutella xylostella*) (= 钻石背蛾 (*Plutella maculipennis*))、小白巢蛾属 (*Prays* spp.)、斜纹夜蛾属 (*Prodenia* spp.)、烟草天蛾属 (*Protoparce* spp.)、粘虫属 (*Pseudaletia* spp.) (例如一星粘虫 (*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.) (例如三化螟 (*Schoenobius bipunctifer*))、白禾螟属 (*Scirpophaga* spp.) (例如稻白螟 (*Scirpophaga innotata*))、黄地老虎 (*Scotia segetum*)、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.)、花生麦蛾 (*Stomopteryx subsecivella*)、透翅蛾属 (*Synanthedon* spp.)、安第斯马铃薯块茎蛾 (*Tecia solanivora*)、大豆夜蛾 (*Thermesia gemmatilis*)、木塞谷蛾 (*Tinea cloacella*)、袋谷蛾 (*Tinea pellionella*)、幕谷蛾 (*Tineola bisselliella*)、卷蛾属 (*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.)；

[0077] 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 (*Grylotalpa* spp.) (例如欧洲蝼蛄 (*Grylotalpa grylotalpa*))、蔗蝗属 (*Hieroglyphus* spp.)、飞蝗属 (*Locusta* spp.) (例如飞蝗 (*Locusta migratoria*))、黑蝗属 (*Melanoplus* spp.) (例如迁飞黑蝗 (*Melanoplus devastator*)、*Paratlanticus ussuriensis*)、沙漠蝗 (*Schistocerca gregaria*)；

[0078] 虱目 (*Phthiraptera*) 的有害物, 例如, 例如畜虱属 (*Damalinia* spp.)、血虱属 (*Haematopinus* spp.)、毛虱属 (*Linognathus* spp.)、虱属 (*Pediculus* spp.)、根瘤蚜 (*Phylloxera vastatrix*)、阴虱 (*Ptirus pubis*)、啮毛虱属 (*Trichodectes* spp.)；

[0079] 啮虫目 (*Psocoptera*) 的有害物, 例如, 粉啮虫属 (*Lepinatus* spp.)、书虱属 (*Liposcelis* spp.)；

[0080] 蚤目 (*Siphonaptera*) 的有害物, 例如, 角叶蚤属 (*Ceratophyllus* spp.)、栉首蚤属 (*Ctenocephalides* spp.) (例如犬栉头蚤 (*Ctenocephalides canis*), 猫栉首蚤

(*Ctenocephalides felis*)、跳蚤(*Pulex irritans*)、穿皮潜蚤(*Tunga penetrans*)、印鼠客蚤(*Xenopsylla cheopis*)；

[0081] 缨翅目(*Thysanoptera*)的有害物,例如,玉米黄呆蓟马(*Anaphothrips obscurus*)、稻蓟马(*Baliothrips biformis*)、葡萄镰蓟马(*Drepanothrips reuteri*)、*Enneothrips flavens*、花蓟马属(*Frankliniella* spp.) (例如烟褐蓟马(*Frankliniella fusca*)、西花蓟马(*Frankliniella occidentalis*)、苏花蓟马(*Frankliniella schultzei*)、麦花蓟马(*Frankliniella tritici*)、越桔花蓟马(*Frankliniella vaccinii*)、威廉期花蓟马(*Frankliniella williamsi*)、阳蓟马属(*Heliothrips* spp.)、温室条篱蓟马(*Hercinothrips femoralis*)、葡萄蓟马(*Rhipiphorothrips cruentatus*)、硬蓟马属(*Scirtothrips* spp.)、小豆蓴带蓟马(*Taeniothrips cardamoni*)、蓟马属(*Thrips* spp.) (例如棕榈蓟马(*Thrips palmi*)、烟蓟马(*Thrips tabaci*))；

[0082] 衣鱼目(*Zygentoma*) (= 缨尾亚目(*Thysanura*))的害虫,例如,栉衣鱼属(*Ctenolepisma* spp.)、衣鱼(*Lepisma saccharina*)、盗火虫(*Lepismodes inquilinus*)、家衣鱼(*Thermobia domestica*)；

[0083] 综合纲(*Symphyla*)的有害物,例如,么蚰属(*Scutigera* spp.) (例如无斑点么蚰(*Scutigera immaculata*))；

[0084] 软体动物门(*Mollusca*)的有害物,例如双壳纲(*Bivalvia*),如饰贝属(*Dreissena* spp.) ,

[0085] 以及腹足纲(*Gastropoda*)的有害物,如阿勇蛞蝓属(*Arion* spp.) (例如黑红阿勇蛞蝓(*Arion ater rufus*))、双脐螺属(*Biomphalaria* spp.)、小泡螺属(*Bulinus* spp.)、野蛞蝓属(*Deroceras* spp.) (例如田灰蛞蝓(*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.)；

[0086] 扁形动物门(*Platyhelminthes*)和线虫纲(*Nematoda*)的动物寄生虫和人寄生虫,例如猫圆线虫属(*Aelurostrongylus* spp.)、裂口线虫属(*Amidostomum* spp.)、钩口线虫属(*Ancylostoma* spp.)、管圆线虫属(*Angiostrongylus* spp.)、异尖属(*Anisakis* spp.)、裸头绦虫属(*Anoplocephala* spp.)、蛔虫属(*Ascaris* spp.)、鸡蛔虫属(*Ascaridia* spp.)、贝利蛔线虫属(*Baylisascaris* spp.)、布鲁丝虫属(*Brugia* spp.)、仰口线虫属(*Bunostomum* spp.)、毛细线虫属(*Capillaria* spp.)、夏柏特线虫属(*Chabertia* spp.)、支睾吸虫属(*Clonorchis* spp.)、古柏线虫属(*Cooperia* spp.)、环体线虫属(*Crenosoma* spp.)、*Cyathostoma* spp.、双腔吸虫属(*Dicrocoelium* spp.)、网尾线虫属(*Dictyocaulus* spp.)、裂头属(*Dipyllobothrium* spp.)、复孔绦虫属(*Dipylidium* spp.)、恶丝虫属(*Dirofilaria* spp.)、龙线虫属(*Dracunculus* spp.)、棘球属(*Echinococcus* spp.)、棘口吸虫属(*Echinostoma* spp.)、蛲虫属(*Enterobius* spp.)、*Eucoleus* spp.、片形属(*Fasciola* spp.)、片吸虫属(*Fascioloides* spp.)、姜片属(*Fasciolopsis* spp.)、类丝虫属(*Filaroides* spp.)、筒线属(*Gongylonema* spp.)、筒线属(*Gyrodactylus* spp.)、丽线虫属(*Habronema* spp.)、血矛线虫属(*Haemonchus* spp.)、*Heligmosomoides* spp.、异刺线虫属(*Heterakis* spp.)、膜壳绦虫属(*Hymenolepis* spp.)、猪圆形属(*Hyostongylus* spp.)、光丝虫属(*Litomosoides* spp.)、罗阿丝虫属(*Loa* spp.)、后圆线虫属(*Metastrongylus*

spp.)、次睾吸虫属 (*Metorchis* spp.)、中殖孔绦虫属 (*Mesocestoides* spp.)、蒙尼茨绦虫属 (*Moniezia* spp.)、缪勒线虫 (*Muellerius* spp.)、板口线虫属 (*Necator* spp.)、细颈线虫属 (*Nematodirus* spp.)、日本圆线虫属 (*Nippostrongylus* spp.)、结节线虫属 (*Oesophagostomum* spp.)、沃鲁线虫属 (*Ollulanus* spp.)、盘尾丝虫属 (*Onchocerca* spp.)、后睾属 (*Opisthorchis* spp.)、*Oslerus* spp.、胃线虫属 (*Ostertagia* spp.)、尖尾线虫属 (*Oxyuris* spp.)、*Paracapillaria* spp.、尖尾线虫属 (*Parafilaria* spp.)、并殖吸虫属 (*Paragonimus* spp.)、同端盘属 (*Paramphistomum* spp.)、副裸头绦虫属 (*Paranoplocephala* spp.)、副蛔虫属 (*Parascaris* spp.)、栓尾线虫属 (*Passalurus* spp.)、原圆线虫属 (*Protostrongylus* spp.)、血吸虫属 (*Schistosoma* spp.)、腹腔丝虫属 (*Setaria* spp.)、旋毛线虫属 (*Spirocerca* spp.)、冠丝虫属 (*Stephanofilaria* spp.)、冠尾线虫属 (*Stephanurus* spp.)、类圆线虫属 (*Strongyloides* spp.)、类圆线虫属 (*Strongylus* spp.)、鸡张口丝虫属 (*Syngamus* spp.)、绦虫属 (*Taenia* spp.)、背带线虫属 (*Teladorsagia* spp.)、吸吮线虫属 (*Thelazia* spp.)、弓蛔线虫属 (*Toxascaris* spp.)、弓蛔虫属 (*Toxocara* spp.)、毛线虫属 (*Trichinella* spp.)、毛毕吸虫属 (*Trichobilharzia* spp.)、毛圆线虫属 (*Trichostrongylus* spp.)、鞭虫属 (*Trichuris* spp.)、钩虫属 (*Uncinaria* spp.)、吴策线虫属 (*Wuchereria* spp.)；

[0087] 线虫纲 (*Nematoda*) 的植物有害物,即植物寄生线虫,尤其是野外垫刃线虫属 (*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*)、诺顿刺线虫 (*Belonolaimus nortoni*))、伞滑刃线虫属 (*Bursaphelenchus* spp.) (例如椰子红环腐线虫 (*Bursaphelenchus cocophilus*)、荒漠伞滑刃线虫 (*Bursaphelenchus eremus*)、松材线虫 (*Bursaphelenchus xylophilus*))、坏死线虫属 (*Cacopaurus* spp.) (例如瘟疫坏死线虫 (*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*)、畸形小环线虫 (*Criconemella rusium*)、薄叶小环线虫 (*Criconemella xenoplax* (= 环腐线虫 (*Mesocriconema xenoplax*))))、轮线虫属 (*Criconemoides* spp.) (例如 *Criconemoides ferniae*、*Criconemoides onoense*、*Criconemoides ornatum*)、双垫刃属 (*Ditylenchus* spp.) (例如续断双垫刃线虫 (*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*))、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.)、拟滑刃线虫属(*Paraphelenchus* spp.)、拟毛刺线虫属(*Paratrichodorus* spp.) (例如次拟毛刺线虫(*Paratrichodorus minor*))、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.) (例如柑桔穿孔线虫(*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.) (例如短粗根毛刺线虫(*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*))、麦线虫属(*Tylenchulus* spp.) (例如柑桔根线虫(*Tylenchulus semipenetrans*))、剑线虫属(*Xiphinema* spp.) (例如标准剑线虫(*Xiphinema index*))；

[0088] 此外,还可防治原生动物(Protozoa)亚门、球虫目(Coccidia)的有害物,例如艾美球虫属(*Eimeria* spp.)。

[0089] 在一定的浓度和施用率下,式(I)的化合物还可任选地用作除草剂、安全剂、生长调节剂或改善植物特性的试剂,用作杀微生物剂和杀配子剂,例如用作杀真菌剂、抗霉菌剂、杀细菌剂、杀病毒剂(包括抗类病毒试剂)或用作抵抗MLO(类支原体生物)和RLO(类立克次氏体生物)的试剂。如果合适,其还可以用作合成其他活性化合物的中间体或前体。

[0090] 制剂

[0091] 本发明还涉及包含至少一种式(I)的化合物的制剂和由其制备的作为农药的使用形式,例如浇灌、滴注和喷洒液体。在某些情况下,使用形式还包含其他农药和/或具有改善作用的佐剂如渗透剂,例如植物油(如油菜籽油、向日葵油)、矿物油(如石蜡油)、植物脂肪酸的烷基酯(如油菜籽油甲酯或大豆油甲酯)、或烷醇烷氧基化物;和/或展着剂(spreaders),例如烷基硅氧烷和/或盐(如有机或无机铵盐或磷盐,例如硫酸铵或磷酸氢二铵);和/或保留促进剂,例如磺基丁二酸二辛酯或羟丙基瓜尔胶聚合物;和/或湿润剂,例如甘油;和/或肥料,例如含铵、含钾或含磷的肥料。

[0092] 常规的制剂为,例如水溶性液体剂(SL)、乳液浓缩剂(EC)、水包乳剂(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Crop Life International记载,以及记载于Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers——由FAO/WHO关于农药标准的联合会制订,2004, ISBN:9251048576。除了一种或多种式(I)的化合物外,所述制剂还任选地包含其他农用化学活性化合物。

[0093] 这些优选地为包含下述物质的制剂或使用形式:助剂,如增量剂、溶剂、自发性促进剂、载体、乳化剂、分散剂、防冻剂、杀生物剂(biocide)、增稠剂;和或其他助剂,如佐剂。在本上下文中,佐剂是增强制剂的生物功效的组分,而该组分本身不具有任何生物功效。佐剂的实例为促进保留、铺展、附着到叶面或渗透的试剂。

[0094] 这些制剂以已知方式制备,例如通过将式(I)的化合物与助剂如增量剂、溶剂和/或固体载体和/或其他助剂如表面活性剂相混合。所述制剂在合适的设备中制备或在施用前或施用过程中制备。

[0095] 所使用的助剂可为适合用于向式(I)的化合物的制剂或由这些制剂制备的使用形式(如即用型(ready-to-use)农药,如喷洒液体或拌种剂产品)赋予特定特性(例如特定的物理、技术和/或生物特性)的物质。

[0096] 合适的增量剂是,例如水、极性和非极性有机化学液体,例如选自:芳族烃或非芳族烃(如石蜡、烷基苯、烷基萘、氯苯)、醇和多元醇(如果合适的话,其还可被取代、醚化和/或酯化)、酮(如丙酮、环己酮)、酯(包括脂肪和油)和(聚)醚、未取代的和取代的胺、酰胺、内酰胺(如N-烷基吡咯烷酮)和内酯、砜和亚砜(如二甲基亚砜)。

[0097] 如果所用的增量剂是水,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;氯代芳族烃和氯代脂肪族烃,如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,如环己烷或石蜡,如矿物油馏分、矿物油和植物油;醇,如丁醇或乙二醇及其醚和酯;酮,如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂,如二甲基甲酰胺和二甲基亚砜;以及水。

[0098] 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,如二甲苯、甲苯或烷基萘;芳族烃或脂肪族烃,如氯苯、氯乙烯、二氯甲烷;脂族烃,如环己烷、石蜡、石油馏分、矿物油和植物油;醇,如甲醇、乙醇、异丙醇、丁醇或乙二醇及其醚和酯;酮,如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂,如二甲基亚砜;以及水。

[0099] 原则上,可使用所有合适的载体。有用的载体尤其包括:例如,铵盐和磨碎的天然矿物,如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、绿坡缕石、蒙脱石或硅藻土;和磨碎的合成矿物质,如细碎的二氧化硅、氧化铝和天然或合成的硅酸盐、树脂、蜡和/或固体肥料。同样可使用这些载体的混合物。用于颗粒剂的有用载体包括:例如,压碎并分级的天然岩石,如方解石、大理石、浮石、海泡石、白云石;以及无机和有机粗粉的合成颗粒;以及有机材料的颗粒,如锯屑、纸、椰壳、玉米穗轴和烟草茎。

[0100] 还可使用液化的气体增量剂或溶剂。特别合适的增量剂或载体是在环境温度和大气压下为气态的那些,例如,气溶胶喷射剂(aerosol propellant gas),如卤代烃,以及丁烷、丙烷、氮气和二氧化碳。

[0101] 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、或这些表面活性剂的混合物的实例为:聚丙烯酸的盐;木素磺酸的盐;苯酚磺酸或萘磺酸的盐;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(优选烷基酚或芳基酚)的缩聚物;磺基丁二酸酯的盐;牛磺酸衍生物(优选牛磺酸烷基酯);聚乙氧基化醇或酚的磷酸酯;多元醇的脂肪酸酯;以及含硫酸根、磺酸根和磷酸根的化合物的衍生物,例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐、蛋白质水解产物、木质素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。如果上述式(I)的化合物之一和/或上述惰性载体之一不溶于水并且当施用在水中进行时,则表面活性剂的存在是有利的。

[0102] 可存在于制剂和源自其的使用形式中的其他助剂包括:染料,例如无机颜料,如氧化铁、氧化钛、普鲁士蓝;和有机染料,如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料;以及营养物和微量营养物,如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

[0103] 其他的组分可以为稳定剂,如低温稳定剂、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂或其他提高化学和/或物理稳定性的试剂。还可存在发泡剂和消泡剂。

[0104] 此外,制剂和源自其的使用形式还可包含下述物质作为其他的助剂:粘着剂,如羧甲基纤维素;以及粉末、颗粒、乳胶形式的天然和合成聚合物,如阿拉伯树胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯;或者天然磷脂,如脑磷脂、卵磷脂和合成磷脂。其他可能的助剂为矿物油和植物油。

[0105] 任选地,其他助剂也可以存在于所述制剂和源自其的使用形式中。这些添加剂的实例为香料、保护胶体、粘合剂(binder)、胶粘剂(adhesive)、增稠剂、触变剂、渗透剂、保留促进剂、稳定剂、螯合剂、络合剂、湿润剂和展着剂。一般而言,式(I)的化合物可与通常用于制剂目的的任何固体或液体添加剂相结合。

[0106] 有用的保留促进剂包括所有那些降低动态表面张力的物质,如磺基丁二酸二辛酯;或增加粘弹性的物质,如羟丙基瓜尔胶聚合物。

[0107] 在本上下文中,合适的渗透剂为所有那些通常用于增强农业化学活性化合物向植物内渗透的物质。在本上下文中,渗透剂通过这样的方式定义:它们由(通常水性)施用液体和/或由喷洒涂层渗透到植物的表皮,从而增加活性化合物在表皮中的移动性的能力。文献(Baur等人,1997,Pesticide Science 51,131-152)中记载的方法可用于测定这种特性。实例包括:醇烷氧基化物,如椰子脂肪乙氧基化物(10)或异十三烷基乙氧基化物(12);脂肪酸酯,如菜籽油甲酯或大豆油甲酯;脂肪胺烷氧基化物,如牛油胺乙氧基化物(15);或铵盐和/或磷盐,如硫酸铵或磷酸氢二铵。

[0108] 所述制剂优选包含0.00000001重量%至98重量%的式(I)的化合物,特别优选0.01重量%至95重量%的式(I)的化合物,更优选0.5重量%至90重量%的式(I)的化合物,基于所述制剂的重量计。

[0109] 在由制剂(尤其是农药)制备的使用形式中的式(I)的化合物的含量可在宽泛的范围内变化。在使用形式中的式(I)的化合物的浓度通常可为0.00000001重量%至95重量%的式(I)的化合物,优选为0.00001重量%至1重量%,基于使用形式的重量计。施用以适合于使用形式的常规方式进行。

[0110] 混合物

[0111] 式(I)的化合物还可以与下述一种或多种合适的如下物质的混合物的形式使用: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、微生物制品、有益物种、除草剂、肥料、鸟驱散剂、植物增强剂(phytotonic)、止繁殖剂、安全剂、化学信息素和/或植物生长调节剂,从而例如拓宽作用谱、延长作用持续时间、提高作用速率、防止排斥或防止抗性发展。另外,这类活性化合物结合物可以改善植物生长和/或对非生物因素的耐受性,如对高温或低温、对干旱或对高水含量或土壤盐度的耐受性。还可能改善开花和结果性能、优化发芽能力和根系发育、促进采收和提高产量、影响熟化、改善采收产品的品质和/或营养价值、延长储存期和/或改善采收产品的加工性能。

[0112] 此外,式(I)的化合物可以与其他活性化合物或化学信息素如引诱剂和/或鸟驱散剂和/或植物活化剂和/或生长调节剂和/或肥料的混合物形式存在。同样地,式(I)的化合物可以与用于改善植物性能如采收材料的生长、产量和品质的试剂的混合物形式使用。

[0113] 在本发明的一个特别的实施方案中,式(I)的化合物为与其他化合物(优选如下

所述的化合物)的混合物的制剂或以由这些制剂制备的使用形式而存在。

[0114] 如果下文提到的化合物之一可以不同互变异构形式存在,则这些形式即使在各种情况下没有被明确提及,同样也包括在内。有用的混合组分的实例为如下化合物:

[0115] 杀昆虫剂/杀螨剂/杀线虫剂

[0116] 本文中以其通用名称所指定的活性化合物是已知的,并且记载在例如农药手册(“The Pesticide Manual”,16<sup>th</sup>Ed.,British Crop Protection Council 2012)中,或者可以在互联网(例如<http://www.alanwood.net/pesticides>)上找到。

[0117] (1) 乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂,例如氨基甲酸酯类,例如棉铃威(alanycarb)、涕灭威(aldicarb)、噁虫威(bendiocarb)、丙硫克百威(benfuracarb)、丁酮威(butocarboxim)、丁酮砜威(butoxycarboxim)、胺甲萘(carbaryl)、卡巴呋喃(carbofuran)、丁硫克百威(carbosulphan)、乙硫苯威(ethiofencarb)、仲丁威(fenobucarb)、伐虫脒(formetanate)、呋线威(furathiocarb)、异丙威(isoprocab)、灭虫威(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)、啮蚜威(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)、毒死蜱(chloropyrifos)、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(disulphoton)、苯硫磷(EPN)、乙硫磷(ethion)、灭线磷(ethoprophos)、伐灭磷(famphur)、苯线磷(fenamiphos)、杀螟松(fenitrothion)、倍硫磷(fenthion)、噻唑磷(fosthiazate)、庚烯磷(heptenophos)、imicyafos、异柳磷(isofenphos)、邻-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸异丙酯、异噁唑啉(isoxathion)、马拉硫磷(malathion)、灭蚜磷(mecarbam)、甲胺磷(methamidophos)、杀扑磷(methidathion)、速灭磷(mevinphos)、久效磷(monocrotophos)、二溴磷(naled)、氧乐果(omethoate)、亚砷磷(oxydemeton-methyl)、对硫磷(parathion)、对硫磷甲酯(parathion-methyl)、稻丰散(phenthoate)、甲拌磷(phorate)、伏杀磷(phosalone)、亚胺硫磷(phosmet)、磷胺(phosphamidon)、胼硫磷(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(sulphotep)、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(triclorfon)和蚜灭磷(vamidothion)。

[0118] (2) GABA-门控氯离子通道拮抗剂,例如环戊二烯有机氯类,例如氯丹(chlordane)和硫丹(endosulphan);或苯基吡啶类(fiproles),例如乙虫腈(ethiprole)和氟虫腈(fipronil)。

[0119] (3) 钠通道调节剂/电压门控钠通道阻滞剂,例如拟除虫菊酯(pyrethroid)类,例如氟丙菊酯(acrinathrin)、丙烯除虫菊酯(allethrin)、d-顺-反丙烯除虫菊酯(d-cis-

trans allethrin)、d-反丙烯除虫菊酯(d-trans allethrin)、联苯菊酯(bifenthrin)、生物烯丙菊酯(bioallethrin)、生物烯丙菊酯S-环戊烯基异构体(bioallethrin S-cyclopentenyl isomer)、生物苜蓿菊酯(bioresmethrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、氟氯氰菊酯(cyfluthrin)、 $\beta$ -氟氯氰菊酯(beta-cyfluthrin)、氯氟氰菊酯(cyhalothrin)、 $\lambda$ -氯氟氰菊酯(lambda-cyhalothrin)、 $\gamma$ -氯氟氰菊酯(gamma-cyhalothrin)、氯氰菊酯(cypermethrin)、 $\alpha$ -氯氰菊酯(alpha-cypermethrin)、 $\beta$ -氯氰菊酯(beta-cypermethrin)、 $\theta$ -氯氰菊酯(theta-cypermethrin)、 $\zeta$ -氯氰菊酯(zeta-cypermethrin)、苯醚氰菊酯[(1R)-反式异构体](cyphenothrin[(1R)-trans isomers])、溴氰菊酯(deltamethrin)、右旋烯炔菊酯[(E,Z)-(1R)异构体](empenthrin[(E,Z)-(1R) isomers])、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)、 $\tau$ -氟胺氰菊酯(tau-fluvalinate)、苜蓿醚(halfenprox)、炔咪菊酯(imiprothrin)、噻恩菊酯(kadethrin)、苜蓿菊酯(permethrin)、苯醚菊酯[(1R)-反式异构体](phenothrin[(1R)-trans isomer])、炔丙菊酯(prallethrin)、除虫菊酯(pyrethrine、pyrethrum)、苜蓿菊酯(resmethrin)、氟硅菊酯(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin)、胺菊酯(tetramethrin)、胺菊酯[(1R)异构体](tetramethrin[(1R) isomers])、四溴菊酯(tralomethrin)和四氟苯菊酯(transfluthrin);或DDT;或甲氧氯。

[0120] (4) 烟碱型乙酰胆碱受体(nAChR)激动剂,例如新烟碱类(neonicotinoids),例如啉虫脒(acetamiprid)、噻虫胺(clothianidin)、呋虫胺(dinotefuran)、吡虫啉(imidacloprid)、烯啉虫胺(nitenpyram)、噻虫啉(thiacloprid)和噻虫嗪(thiamethoxam)或尼古丁(nicotine)或氟啉虫胺脒(sulphoxaflor)。

[0121] (5) 烟碱乙酰胆碱受体(nAChR)的变构激活剂,例如多杀菌素类(spinosyns),如乙基多杀菌素(spinetoram)和多杀菌素(spinosad)。

[0122] (6) 氯离子通道活化剂,例如,阿维菌素类/米尔倍霉素类(avermectins/milbemycins),例如阿维菌素(abamectin)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐(emamectin benzoate)、雷皮菌素(lepimectin)和灭螨菌素(milbemectin)。

[0123] (7) 保幼激素模仿物,例如,保幼激素类似物如烯虫乙酯(hydroprene)、烯虫炔酯(kinoprene)和烯虫酯(methoprene)或苯氧威(fenoxycarb)或蚊蝇醚(pyriproxyfen)。

[0124] (8) 具有未知的或非特异性作用机制的活性化合物,例如

[0125] 烷基卤化物,例如甲基溴化物和其他烷基卤化物;或氯化苦(chloropicrine)或硫酸氟或硼砂或吐酒石(tartar emetic)。

[0126] (9) 选择性拒食剂,例如吡蚜酮(pymetrozine)或氟啉虫酰胺(flonicamid)。

[0127] (10) 螨生长抑制剂,例如四螨嗪、噻螨酮和氟螨嗪(diflovidazin)或乙螨唑(etoxazole)。

[0128] (11) 昆虫肠膜的微生物干扰剂,例如苏云金芽孢杆菌以色列亚种(*Bacillus thuringiensis* subspecies *israelensis*)、球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus*)、苏云金芽孢杆菌鮎泽亚种(*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BT植物蛋白:Cry1Ab、

Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab1。

[0129] (12) 氧化磷酸化抑制剂、ATP干扰剂,例如丁醚脲或有机锡化合物,例如三唑锡、三环锡和苯丁锡(fenbutatin oxide)或克螨特(propargite)或四氯杀螨砜(tetradifon)。

[0130] (13) 中断H<sup>+</sup>质子梯度的氧化磷酸化去耦剂,例如虫螨腈(chlorfenapyr)、二硝甲酚(DNOC)和氟虫胺(sulphluramid)。

[0131] (14) 烟碱型乙酰胆碱受体拮抗剂,例如杀虫磺(bensultap)、杀螟丹盐酸盐(cartap hydrochloride)、杀虫环(thiocyclam)和杀虫双(thiosultap-sodium)。

[0132] (15) 几丁质生物合成抑制剂,0型,例如双三氟虫脲(bistrifluron)、定虫隆(chlofluazuron)、除虫脲(diflubenzuron)、氟环脲(flucycloxaduron)、氟虫脲(flufenoxuron)、氟铃脲(hexaflumuron)、虱螨脲(lufenuron)、双苯氟脲(novaluron)、多氟脲(noviflumuron)、氟苯脲(teflubenzuron)和杀铃脲(triflumuron)。

[0133] (16) 几丁质生物合成抑制剂,1型,例如噻嗪酮(buprofezin)。

[0134] (17) 蜕皮抑制剂(尤其对于双翅目,即双翅类),例如灭蝇胺(cyromazine)。

[0135] (18) 蜕皮激素受体激动剂,例如环虫酰胺(chromafenozide)、氯虫酰胺(halofenozide)、甲氧虫酰胺(methoxyfenozide)和虫酰胺(tebufenozide)。

[0136] (19) 章鱼胺能激动剂,例如双甲脒(amitraz)。

[0137] (20) 复合物-III型电子传递抑制剂,例如氟蚁腓(hydramethylnone),或灭螨醌(acequinocyl),或啞螨酯(flucrypyrim)。

[0138] (21) 复合物-I型电子传递抑制剂,例如METI杀螨剂,例如啞螨醚(fenazaquin)、啞螨酯(fenpyroximate)、啞螨醚(pyrimidifen)、啞螨灵(pyridaben)、吡啶啉(tebufenpyrad)和啞虫酰胺(tolfenpyrad);或鱼藤酮(rotenone)(鱼藤)。

[0139] (22) 电压门控钠通道阻断剂,例如茚虫威(indoxacarb)或氟氟虫脒(metaflumizone)。

[0140] (23) 乙酰基-CoA羧化酶的抑制剂,例如季酮酸(tetronic)和特特拉姆酸(tetramic acid)衍生物,例如螺螨酯(spirodiclofen)、螺甲螨酯(spiromesifen)和螺虫乙酯(spirotetramat)。

[0141] (24) 复合物-IV型电子传递抑制剂,例如磷类,如磷化铝、磷化钙、磷化氢和磷化锌;或氰化物。

[0142] (25) 复合物-II型电子传递抑制剂,例如腈吡啶酯(cyenoxyrafen)和丁氟螨酯(cyflumetofen)。

[0143] (28) 鱼尼丁受体效应剂,例如二酰胺类,如氯虫苯甲酰胺(chlorantraniliprole)、溴氰虫酰胺(cyantraniliprole)和氟虫双酰胺(flubendiamide);

[0144] 其他活性化合物,例如afidopyropen、印楝素(azadirachtin)、benclorbutaz、苯氧脒(benzoximate)、联苯肼酯(bifenazate)、溴螨酯(bromopropylate)、灭螨锰(chinomethionat)、冰晶石(cryolite)、三氯杀螨醇(dicofol)、氟啶啉(diflovidazin)、氟噻虫砜(flusulfone)、flometoquin、啞虫胺(flufenimer)、氟菌酯(flufenoxystrobin)、丁虫脒(flufiprole)、氟吡菌酰胺(flupyradifurone)、啞虫酰胺(fufenozide)、heptafluthrin、氯噻啉(imidacloprid)、异菌脲(iprodione)、

氯氟醚菊酯 (meperfluthrin)、哌虫啉 (paichongding)、pyflubumide、pyrifluquinazon、嘧啶胺 (pyriminostrobin)、四氟醚菊酯 (tetramethylfluthrin) 和碘甲烷 (iodomethane); 以及基于坚强芽孢杆菌 (*Bacillus firmus*, I-1582, BioNeem, Votivo) 的制品, 以及下列化合物: 3-溴-N-{2-溴-4-氯-6-[(1-环丙基乙基)氨基甲酰基]苯基}-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-甲酰胺 (由W02005/077934已知) 和1-{2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亚磺酰基]苯基}-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺 (由W02006/043635已知)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吡啶-3,4'-哌啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮 (由W02003/106457已知)、2-氯-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]哌啶-4-基}-4-(三氟甲基)苯基]异烟酰胺 (由W02006/003494已知)、3-(2,5-二甲基苯基)-4-羟基-8-甲氧基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮 (由W02009/049851已知)、3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙基碳酸酯 (由W02009/049851已知)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基哌啶-1-基)-5-氟嘧啶 (由W02004/099160已知)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3-氯苯基)嘧啶 (由W02003/076415已知)、PF1364 (CAS登记号 1204776-60-2)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-{2-氧代-2-[(2,2,2-三氟乙基)氨基]乙基}苯甲酰胺 (由W02005/085216已知)、4-[5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-N-{2-氧代-2-[(2,2,2-三氟乙基)氨基]乙基}-1-萘甲酰胺 (由W02009/002809已知)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)-5-氯-3-甲基苯甲酰基]-2-甲基肼甲酸甲酯 (由W02005/085216已知)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)-5-氟基-3-甲基苯甲酰基]-2-乙基肼甲酸甲酯 (由W02005/085216已知)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)-5-氟基-3-甲基苯甲酰基]-2-甲基肼甲酸甲酯 (由W02005/085216已知)、2-[3,5-二溴-2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)苯甲酰基]-2-乙基肼甲酸甲酯 (由W02005/085216已知)、1-(3-氯吡啶-2-基)-N-[4-氟基-2-甲基-6-(甲基氨基甲酰基)苯基]-3-[[5-(三氟甲基)-2H-四唑-2-基]甲基]-1H-吡啶-5-甲酰胺 (由W02010/069502已知)、N-[2-(5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-甲酰胺 (由CN102057925已知)、3-氯-N-(2-氟基丙-2-基)-N-[4-(1,1,1,2,3,3,3-七氟丙-2-基)-2-甲基苯基]酞酰胺 (由W02012/034472已知)、8-氯-N-[(2-氯-5-甲氧基苯基)磺酰基]-6-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺 (由W02010/129500已知)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-(1-氧代硫杂环丁烷-3-基)苯甲酰胺 (由W02009/080250已知)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-(1-氧代硫杂环丁烷-3-基)苯甲酰胺 (由W02012/029672已知)、1-[(2-氯-1,3-噻唑-5-基)甲基]-4-氧代-3-苯基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶-1-鎓-2-酚盐 (由W02009/099929已知)、1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-4-氧代-3-苯基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶-1-鎓-2-酚盐 (由W02009/099929已知)、(5S,8R)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-9-硝基-2,3,5,6,7,8-六氢-1H-5,8-环氧咪唑并[1,2-a]吡啶 (由W02010/069266已知)、(2E)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-N'-硝基-2-亚戊基肼苯甲脒 (由W02010/060231已知)、4-(3-{2,6-二氯-4-[(3,3-二氯丙-2-烯-1-基)氧基]苯氧基}丙氧基)-2-甲氧基-6-(三氟甲基)嘧啶 (由CN101337940已知)、N-[2-(叔丁基氨基甲酰基)-4-氯-6-甲基苯基]-1-(3-氯吡啶-2-基)-3-(氟甲氧基)-1H-吡啶-5-甲酰胺 (由

WO2008/134969已知)。

[0145] 杀真菌剂

[0146] 本文中以其通用名称所指定的活性化合物是已知的并且记载在例如“Pesticide Manual”或互联网(例如:<http://www.alanwood.net/pesticides>)上。

[0147] (1) 麦角甾醇生物合成抑制剂,例如(1.1)艾敌吗啉(aldimorph)、(1.2)戊环唑(azaconazole)、(1.3)联苯三唑醇(bitertanol)、(1.4)糠菌唑(bromuconazole)、(1.5)环丙唑醇(cyproconazole)、(1.6)苄氯三唑醇(diclobutrazole)、(1.7)噁醚唑(difenoconazole)、(1.8)烯唑醇(diniconazole)、(1.9)高效烯唑醇(diniconazole-M)、(1.10)吗菌灵(dodemorph)、(1.11)吗菌灵乙酸盐(dodemorph acetate)、(1.12)氟环唑(epoxiconazole)、(1.13)乙环唑(etaconazole)、(1.14)氟苯嘧啶醇(fenarimol)、(1.15)腈苯唑(fenbuconazole)、(1.16)环酰菌胺(fenhexamid)、(1.17)苯锈啶(fenpropidin)、(1.18)丁苯吗啉(fenpropimorph)、(1.19)氟喹唑(flquinconazole)、(1.20)调啞醇(flurprimidol)、(1.21)氟硅唑(flusilazole)、(1.22)粉唑醇(flutriafole)、(1.23)呋菌唑(furconazole)、(1.24)顺呋醚唑(furconazole-cis)、(1.25)己唑醇(hexaconazole)、(1.26)烯菌灵(imazalil)、(1.27)烯菌灵硫酸盐(imazalil sulfate)、(1.28)酰胺唑(imibenconazole)、(1.29)种菌唑(ipconazole)、(1.30)叶菌唑(metconazole)、(1.31)腈菌唑(myclobutanil)、(1.32)萘替芬(naftifine)、(1.33)氟苯嘧啶醇(nuarimol)、(1.34)噁咪唑(oxpoconazole)、(1.35)多效唑(paclobutrazol)、(1.36)稻瘟酯(pefurazoate)、(1.37)戊菌唑(penconazole)、(1.38)粉病灵(piperalin)、(1.39)咪鲜胺(prochloraz)、(1.40)丙环唑(propiconazole)、(1.41)丙硫菌唑(prothioconazole)、(1.42)稗草畏(pyributicarb)、(1.43)啞斑肟(pyrifenoxy)、(1.44)唑啉菌酮(quinconazole)、(1.45)硅氟唑(simeconazole)、(1.46)螺环菌胺(spiroxamine)、(1.47)戊唑醇(tebuconazole)、(1.48)特比萘芬(terbinafine)、(1.49)氟醚唑(tetraconazole)、(1.50)三唑酮(triadimefon)、(1.51)三唑醇(triadimenol)、(1.52)克啉菌(tridemorph)、(1.53)氟菌唑(triflumizole)、(1.54)噻氨灵(triforine)、(1.55)灭菌唑(triticonazole)、(1.56)烯效唑(uniconazole)、(1.57)精烯效唑(uniconazole-p)、(1.58)烯霜苄唑(viniconazole)、(1.59)伏立康唑(voriconazole)、(1.60)1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)环庚醇、(1.61)1-(2,2-二甲基-2,3-二氢-1H-茚-1-基)-1H-咪唑-5-甲酸甲酯、(1.62)N'-{5-(二氟甲基)-2-甲基-4-[3-(三甲基硅烷基)丙氧基]苯基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.63)N-乙基-N-甲基-N'-{2-甲基-5-(三氟甲基)-4-[3-(三甲基硅烷基)丙氧基]苯基}甲脒、(1.64)邻-[1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁烷-2-基]1H-咪唑-1-硫代甲酸酯、(1.65)啞菌噁唑(pyrisoxazole)。

[0148] (2) 呼吸抑制剂(呼吸链抑制剂),例如(2.1)联苯吡菌胺(bixafen)、(2.2)啞酰菌胺(boscalid)、(2.3)萎锈灵(carboxin)、(2.4)氟啞菌胺(diflumetorim)、(2.5)甲呋酰胺(fenfuram)、(2.6)氟吡菌酰胺(flupyram)、(2.7)氟酰胺(flutolanil)、(2.8)氟唑菌酰胺(fluxapyroxad)、(2.9)呋吡菌胺(furametpyr)、(2.10)拌种胺(furmecycloxy)、(2.11)吡啞萘菌胺(isopyrazam)顺式差向异构外消旋体1RS、4SR、9RS和反式差向异构外消旋体1RS、4SR、9SR的混合物、(2.12)吡啞萘菌胺(反式差向异构外消旋体)、(2.13)吡啞萘菌胺(反式差向异构对映异构体1R、4S、9S)、(2.14)吡啞萘菌胺(反式差向异构对映异构体1S、4R、9R)、



(2.15) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构外消旋体1RS、4SR、9RS)、(2.16) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构对映异构体1R、4S、9R)、(2.17) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构对映异构体1S、4R、9S)、(2.18) 灭锈胺(mepronil)、(2.19) 氧化萎锈灵(oxycarboxin)、(2.20) 氟唑菌苯胺(penflufen)、(2.21) 吡噻菌胺(penthiopyrad)、(2.22) 氟唑环菌胺(sedaxane)、(2.23) 噻氟菌胺(thifluzamide)、(2.24) 1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.25) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.26) 3-(二氟甲基)-N-[4-氟-2-(1,1,2,3,3,3-六氟丙氧基)苯基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.27) N-[1-(2,4-二氯苯基)-1-甲氧基丙-2-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.28) 5,8-二氟-N-[2-(2-氟-4-[[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]氧基]苯基)乙基]喹唑啉-4-胺、(2.29) 苯并烯氟菌唑(benzovindiflupyr)、(2.30) N-[(1S,4R)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-桥亚甲基-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺和(2.31) N-[(1R,4S)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-桥亚甲基-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.32) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.33) 1,3,5-三甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.34) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.35) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[(1R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.36) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[(1S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.37) 3-(二氟甲基)-1-甲基-1-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.38) 3-(二氟甲基)-1-甲基-1-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.39) 1,3,5-三甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.40) 1,3,5-三甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.41) 麦锈灵(benodanil)、(2.42) 2-氯-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)吡啶-3-甲酰胺、(2.43) isofetamid。

[0149] (3) 作用于呼吸链的复合物-III的呼吸抑制剂(呼吸链抑制剂),例如,(3.1) 唑啉菌胺(ametocetradin)、(3.2) 安美速(amisulbrom)、(3.3) 嘧菌酯(azoxystrobin)、(3.4) 氰霜唑(cyazofamid)、(3.5) 甲香菌酯(coumethoxystrobin)、(3.6) 丁香菌酯(coumoxystrobin)、(3.5) 醚菌胺(dimoxystrobin)、(3.8) 烯肟菌酯(enestroburin)、(3.9) 噁唑菌酮(famoxadone)、(3.10) 咪唑菌酮(fenamidone)、(3.11) 氟菌螬酯(flufenoxystrobin)、(3.12) 氟嘧菌酯(fluxastrobin)、(3.13) 醚菌酯(kresoxim-methyl)、(3.14) 苯氧菌胺(metominostrobin)、(3.15) 肟醚菌胺(orysastrobin)、(3.16) 啉氧菌酯(picoxystrobin)、(3.17) 唑菌胺酯(pyraclostrobin)、(3.18) 唑胺菌酯(pyrametostrobin)、(3.19) 唑胺菌酯(pyraoxystrobin)、(3.20) 吡菌苯威(pyribencarb)、(3.21) 氯啉菌酯(triclopyricarb)、(3.22) 肟菌酯(trifloxystrobin)、(3.23) (2E)-2-(2-[[6-(3-氯-2-甲基苯氧基)-5-氟嘧啶-4-基]氧基]苯基)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、(3.24) (2E)-2-(甲氧基亚胺)-N-甲基-2-(2-[[[(1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]氨基]氧基]甲基]苯基)乙酰胺、(3.25) (2E)-2-(甲氧基亚胺)-N-甲基-2-[2-[(E)-[[1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基]亚氨基]甲基]苯基]乙酰胺、(3.26) (2E)-2-[2-[[[(1E)-1-(3-[[E)-1-氟-2-苯乙烯基]氧基]苯基]亚乙基]氨基]氧基]甲基]苯基]-2-(甲氧基亚氨基)-

N-甲基乙酰胺、(3.27) (2E)-2-[2-[[[(2E,3E)-4-(2,6-二氯苯基)丁-3-烯-2-亚基]氨基]氧基]甲基]苯基]-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、(3.28) 2-氯-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)吡啶-3-甲酰胺、(3.29) 5-甲氧基-2-甲基-4-(2-[[[(1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]氨基]氧基]甲基]苯基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮、(3.30) (2E)-2-[2-[[[环丙基[(4-甲氧基苯基)亚氨基]甲基]硫基]甲基]苯基]-3-甲氧基丙-2-烯酸甲酯、(3.31) N-(3-乙基-3,5,5-三甲基环己基)-3-(甲酰基氨基)-2-羟基苯甲酰胺、(3.32) 2-[2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基]-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺。

[0150] (4) 有丝分裂和细胞分裂抑制剂,例如(4.1) 苯菌灵(benomyl)、(4.2) 多菌灵(carbendazim)、(4.3) chlorfenazole、(4.4) 乙霉威(diethofencarb)、(4.5) 噻唑菌胺(ethaboxam)、(4.6) 氟吡菌胺(fluopicolid)、(4.7) 麦穗宁(fuberidazole)、(4.8) 戊菌隆(pencycuron)、(4.9) 噻苯咪唑(thiabendazole)、(4.10) 甲基硫菌灵(thiophanate-methyl)、(4.11) 硫菌灵(thiophanate)、(4.12) 苯酰菌胺(zoxamide)、(4.13) 5-氯-7-(4-甲基哌啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶以及(4.14) 3-氯-5-(6-氯吡啶-3-基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)哒嗪。

[0151] (5) 具有多位点活性的化合物,例如,(5.1) 波尔多液(bordeaux mixture)、(5.2) 敌菌丹(captafol)、(5.3) 克菌丹(captan)、(5.4) 百菌清(chlorothalonil)、(5.5) 铜制剂例如氢氧化铜、(5.6) 环烷酸铜(copper naphthenate)、(5.7) 氧化铜、(5.8) 氧氯化铜(copper oxychloride)、(5.9) 硫酸铜(copper sulfate)、(5.10) 抑菌灵(dichlofluanid)、(5.11) 二噻农(dithianon)、(5.12) 多果定(dodine)、(5.13) 多果定游离碱(dodinefree base)、(5.14) 福美铁(ferbam)、(5.15) 氟灭菌丹(fluorofolpet)、(5.16) 灭菌丹(folpet)、(5.17) 双胍辛盐(guazatine)、(5.18) 双胍辛乙酸盐(guazatine acetate)、(5.19) 双胍辛胺(iminoctadine)、(5.20) 双胍辛胺苯磺酸盐(iminoctadine albesilate)、(5.21) 双胍辛胺三乙酸盐(iminoctadine triacetate)、(5.22) 代森锰铜(mancopper)、(5.23) 代森锰锌(mancozeb)、(5.24) 代森锰(maneb)、(5.25) 代森联(metiram)、(5.26) 代森联锌(zinc metiram)、(5.27) 喹啉铜(copper-oxine)、(5.28) 丙烷脒(propamidine)、(5.29) 丙森锌(propineb)、(5.30) 硫和硫制剂如多硫化钙、(5.31) 福美双(thiram)、(5.32) 对甲抑菌灵(tolylfluanid)、(5.33) 代森锌(zineb)、(5.34) 福美锌(ziram)和(5.35) 敌菌灵(anilazine)。

[0152] (6) 抗性诱导剂,例如,(6.1) 苯并噻二唑(acibenzolar-S-methyl)、(6.2) 异噻菌胺(isotianil)、(6.3) 噻菌灵(probenazole)、(6.4) 噻酰菌胺(tiadinil)和(6.5) 海带多糖(laminarin)。

[0153] (7) 氨基酸和蛋白质生物合成抑制剂,例如,(7.1)、(7.2) 灭瘟素(blasticidin-S)、(7.3) 啞菌环胺(cyprodinil)、(7.4) 春雷霉素(kasugamycin)、(7.5) 春雷霉素盐酸盐水合物(kasugamycin hydrochloride hydrate)、(7.6) 啞菌胺(mepanipyrim)、(7.7) 啞霉胺(pyrimethanil)、(7.8) 3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉以及(7.9) 土霉素(oxytetracycline)和(7.10) 链霉素(streptomycin)。

[0154] (8) ATP生成抑制剂,例如,(8.1) 薯瘟锡(fentin acetate)、(8.2) 三苯锡氯(fentin chloride)、(8.3) 毒菌锡(fentin hydroxide)、(8.4) 硅噻菌胺(silthiofam)。

[0155] (9) 细胞壁合成抑制剂,例如(9.1) 苯噻菌胺(benthiavalicarb)、(9.2) 烯酰吗啉

(dimethomorph)、(9.3) 氟吗啉 (flumorph)、(9.4) 缬霉威 (iprovalicarb)、(9.5) 双炔酰菌胺 (mandipropamid)、(9.6) 多抗霉素 (polyoxins)、(9.7) 保粒霉素 (polyoxorim)、(9.8) 井冈霉素A (validamycin A)、(9.9) 缬菌胺 (valifenalate) 和 (9.10) 多氧菌素B (polyoxin B)。

[0156] (10) 脂类和膜合成抑制剂,例如,(10.1) 联苯、(10.2) 地茂散 (chloroneb)、(10.3) 氯硝胺 (dicloran)、(10.4) 克瘟散 (edifenphos)、(10.5) 土菌灵 (etridiazole)、(10.6) 依杜卡 (iodocarb)、(10.7) 异稻瘟净 (iprobenfos)、(10.8) 稻瘟灵 (isoprothiolane)、(10.9) 霜霉威 (propamocarb)、(10.10) 霜霉威盐酸盐 (propamocarb hydrochloride)、(10.11) 硫菌威 (prothiocarb)、(10.12) 吡菌磷 (pyrazophos)、(10.13) 五氯硝基苯 (quintozene)、(10.14) 四氧硝基苯 (tecnazene) 和 (10.15) 甲基立枯磷 (tolclofos-methyl)。

[0157] (11) 黑色素生物合成抑制剂,例如(11.1) 加普胺 (carpropamid)、(11.2) 双氯氰菌胺 (diclocymet)、(11.3) 稻瘟酰胺 (fenoxanil)、(11.4) 四氯苯酞 (fthalide)、(11.5) 咯喹酮 (pyroquilon)、(11.6) 三环唑 (tricyclazole) 以及 (11.7) 2,2,2-三氟乙基 {3-甲基-1-[ (4-甲基苯甲酰基) 氨基] 丁烷-2-基} 氨基甲酸酯。

[0158] (12) 核酸合成抑制剂,例如,(12.1) 苯霜灵 (benalaxyl)、(12.2) 高效苯霜灵 (benalaxyl-M) (kiralaxyl)、(12.3) 磺酸丁嘧啶 (bupirimate)、(12.4) clozylacon、(12.5) 甲菌定 (dimethirimol)、(12.6) 乙菌定 (ethirimol)、(12.7) 呋霜灵 (furalaxyl)、(12.8) 噁霉灵 (hymexazol)、(12.9) 甲霜灵 (metalaxyl)、(12.10) 高效甲霜灵 (metalaxyl-M) (mefenoxam)、(12.11) 甲呋酰胺 (ofurace)、(12.12) 噁霜灵 (oxadixyl)、(12.13) 噁啉酸 (oxolinic acid) 和 (12.14) 辛噁酮 (octhilinone)。

[0159] (13) 信号转导抑制剂,例如,(13.1) 乙菌利 (chlozolinat)、(13.2) 拌种咯 (fenciclonil)、(13.3) 咯菌腈 (fludioxonil)、(13.4) 异菌脲 (iprodione)、(13.5) 腐霉利 (procymidone)、(13.6) 喹氧灵 (quinoxifen)、(13.7) 乙烯菌核利 (vinclozolin) 和 (13.8) 丙氧喹啉 (proquinazid)。

[0160] (14) 解偶联剂,例如,(14.1) 乐杀螨 (binapacryl)、(14.2) 敌螨普 (dinocap)、(14.3) 噻菌腈 (ferimzone)、(14.4) 氟啶胺 (fluazinam) 和 (14.5) 消螨多 (neptyldinocap)。

[0161] (15) 其他化合物,例如,(15.1) 苯噻硫氰 (benthiazole)、(15.2) bethoxazine、(15.3) 卡巴西霉素 (capsimycin)、(15.4) 香芹酮 (carvone)、(15.5) 灭螨猛 (chinomethionat)、(15.6) pyriofenone (chlazafenone)、(15.7) 硫杂灵 (cufraneb)、(15.8) 环氟菌胺 (cyflufenamid)、(15.9) 霜脲氰 (cymoxanil)、(15.10) 环丙磺酰胺 (cyprosulphamide)、(15.11) 棉隆 (dazomet)、(15.12) 咪菌威 (debacarb)、(15.13) 双氯酚 (dichlorophen)、(15.14) 哒菌酮 (diclomezine)、(15.15) 野燕枯 (difenzoquat)、(15.16) 野燕枯甲基硫酸盐 (difenzoquat methylsulphate)、(15.17) 二苯胺 (diphenylamine)、(15.18) EcoMate、(15.19) 胺苯吡菌酮 (fenpyrazamine)、(15.20) 氟联苯菌 (flumetover)、(15.21) fluorimid、(15.22) 磺菌胺 (flusulphamide)、(15.23) flutianil、(15.24) 三乙膦酸铝 (fosetyl-aluminium)、(15.25) 乙膦酸钙 (fosetyl-calcium)、(15.26) 乙膦酸钠 (fosetyl-sodium)、(15.27) 六氯苯 (hexachlorobenzene)、(15.28) irumamycin、(15.29) 磺菌威 (methasulphocarb)、(15.30) 异硫氰酸甲酯 (methyl isothiocyanate)、(15.31) 苯菌酮 (metrafenone)、(15.32) 灭粉霉素 (mildiomycin)、(15.33) 游霉素 (natamycin)、(15.34)

二甲基二硫代氨基甲酸镍(nickel dimethyldithiocarbamate)、(15.35) 酞菌酯(nitrothal-isopropyl)、(15.36) 辛噻酮(octhilinone)、(15.37) oxamocarb、(15.38) oxyfenthiin、(15.39) 五氯苯酚(pentachlorophenol)及其盐、(15.40) 苯醚菊酯(phenothrin)、(15.41) 磷酸及其盐、(15.42) 霜霉威-乙膦酸盐(propamocarb-fosetylalte)、(15.43) 丙醇菌素钠(propanosine-sodium)、(15.44) 丁吡吗啉(pyrimorph)、(15.45) (2E)-3-(4-叔丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(吗啉-4-基)丙-2-烯-1-酮、(15.46) (2Z)-3-(4-叔丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(吗啉-4-基)丙-2-烯-1-酮、(15.47) 吡咯尼林(pyrrolnitrin)、(15.48) tebufloquin、(15.49) 叶枯酞(tecloftalam)、(15.50) 甲磺菌胺(tolnifanide)、(15.51) 咪唑嗪(triazoxide)、(15.52) 水杨菌胺(trichlamide)、(15.53) 氰菌胺(zarilamid)、(15.54) (3S,6S,7R,8R)-8-苄基-3-[(3-[(异丁酰氧基)甲氧基]-4-甲氧基吡啶-2-基)羰基]氨基]-6-甲基-4,9-二氧代-1,5-二氧杂环壬烷-7-基-2-甲基丙酸酯、(15.55) 1-(4-{4-[5R]-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(15.56) 1-(4-{4-[5S]-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(15.57) 1-(4-{4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(15.58) 1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁烷-2-基-1H-咪唑-1-甲酸酯、(15.59) 2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺酰基)吡啶、(15.60) 2,3-二丁基-6-氯噻吩并[2,3-d]噻啶-4(3H)-酮、(15.61) 2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二噻英并[2,3-c:5,6-c']二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮、(15.62) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[5R]-5-苄基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)乙酮、(15.63) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[5S]-5-苄基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)乙酮、(15.64) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-{4-[4-(5-苄基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基)-1,3-噻唑-2-基]哌啶-1-基}乙酮、(15.65) 2-丁氧基-6-碘代-3-丙基-4H-苯并吡喃-4-酮、(15.66) 2-氯-5-[2-氯-1-(2,6-二氟-4-甲氧基苯基)-4-甲基-1H-咪唑-5-基]吡啶、(15.67) 2-苄基苯酚及其盐、(15.68) 3-(4,4,5-三氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉、(15.69) 3,4,5-三氯吡啶-2,6-二甲腈、(15.70) 3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基哒嗪、(15.71) 4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基哒嗪、(15.72) 5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇、(15.73) 5-氯-N'-苄基-N'-(丙-2-炔-1-基)噻吩-2-磺酰肼、(15.74) 5-氟-2-[(4-氟苄基)氧基]噻啶-4-胺、(15.75) 5-氟-2-[(4-甲基苄基)氧基]噻啶-4-胺、(15.76) 5-甲基-6-辛基[1,2,4]三唑并[1,5-a]噻啶-7-胺、(15.77) (2Z)-3-氨基-2-氰基-3-苄基丙烯酸乙酯、(15.78) N'-(4-{[3-(4-氯苄基)-1,2,4-噻二唑-5-基]氧基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.79) N-(4-氯苄基)-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苄基]丙酰胺、(15.80) N-[4-氯苄基(氰基)甲基]-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苄基]丙酰胺、(15.81) N-[5-溴-3-氯吡啶-2-基]甲基]-2,4-二氯烟酰胺、(15.82) N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯烟酰胺、(15.83) N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2-氟-4-碘烟酰胺、(15.84) N-{(E)-[(环丙基甲氧基)亚氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苄基乙酰胺、(15.85) N-{(Z)-[(环丙基甲氧基)亚氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苄基

乙酰胺、(15.86) N'-{4-[ (3-叔丁基-4-氰基-1,2-噁唑-5-基) 氧基]-2-氯-5-甲基苯基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.87) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-(1,2,3,4-四氢化萘-1-基)-1,3-噁唑-4-甲酰胺、(15.88) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-[(1R)-1,2,3,4-四氢化萘-1-基]-1,3-噁唑-4-甲酰胺、(15.89) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-[(1S)-1,2,3,4-四氢化萘-1-基]-1,3-噁唑-4-甲酰胺、(15.90) {6-[( (1-甲基-1H-四唑-5-基) (苯基) 亚甲基) 氨基] 氧基} 甲基吡啶-2-基} 氨基甲酸戊酯、(15.91) 吩嗪-1-甲酸、(15.92) 喹啉-8-醇、(15.93) 喹啉-8-醇硫酸盐 (2:1)、(15.94) {6-[( (1-甲基-1H-四唑-5-基) (苯基) 亚甲基) 氨基] 氧基} 甲基吡啶-2-基} 氨基甲酸叔丁酯、(15.95) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[2'-(三氟甲基) 联苯-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.96) N-(4'-氯联苯-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.97) N-(2',4'-二氯联苯-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.98) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(三氟甲基) 联苯-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.99) N-(2',5'-二氟联苯-2-基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.100) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基) 联苯-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.101) 5-氟-1,3-二甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基) 联苯-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.102) 2-氯-N-[4'-(丙-1-炔-1-基) 联苯-2-基]烟酰胺、(15.103) 3-(二氟甲基)-N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基) 联苯-2-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.104) N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基) 联苯-2-基]-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.105) 3-(二氟甲基)-N-(4'-乙炔基联苯-2-基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.106) N-(4'-乙炔基联苯-2-基)-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.107) 2-氯-N-(4'-乙炔基联苯-2-基) 烟酰胺、(15.108) 2-氯-N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基) 联苯-2-基]烟酰胺、(15.109) 4-(二氟甲基)-2-甲基-N-[4'-(三氟甲基) 联苯-2-基]-1,3-噁唑-5-甲酰胺、(15.110) 5-氟-N-[4'-(3-羟基-3-甲基丁-1-炔-1-基) 联苯-2-基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.111) 2-氯-N-[4'-(3-羟基-3-甲基丁-1-炔-1-基) 联苯-2-基]烟酰胺、(15.112) 3-(二氟甲基)-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基) 联苯-2-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.113) 5-氟-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基) 联苯-2-基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.114) 2-氯-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基) 联苯-2-基]烟酰胺、(15.115) (5-溴-2-甲氧基-4-甲基吡啶-3-基) (2,3,4-三甲氧基-6-甲基苯基) 甲酮、(15.116) N-[2-(4-{[3-(4-氯苯基) 丙-2-炔-1-基] 氧基}-3-甲氧基苯基) 乙基]-N2-(甲基磺酰基) 缬氨酰胺、(15.117) 4-氧代-4-[(2-苯基乙基) 氨基] 丁酸、(15.118) {6-[( (Z) -(1-甲基-1H-四唑-5-基) (苯基) 亚甲基) 氨基] 氧基} 甲基吡啶-2-基} 氨基甲酸丁-3-炔-1-基酯、(15.119) 4-氨基-5-氟嘧啶-2-醇 (互变异构形式: 4-氨基-5-氟嘧啶-2(1H)-酮)、(15.120) 3,4,5-三羟基苯甲酸丙酯、(15.121) 1,3-二甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.122) 1,3-二甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.123) 1,3-二甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.124) [3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基] (吡啶-3-基) 甲醇、(15.125) (S)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基] (吡啶-3-基) 甲醇、(15.126) (R)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基] (吡啶-3-

基) 甲醇、(15.127) 2- {[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.128) 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、(15.129) 5-(烯丙基硫基)-1- {[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-1H-1,2,4-三唑、(15.130) 2-[1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.131) 2- {[rel (2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.132) 2- {[rel (2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.133) 1- {[rel (2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(15.134) 1- {[rel (2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(15.135) 5-(烯丙基硫基)-1- {[rel (2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-1H-1,2,4-三唑、(15.136) 5-(烯丙基硫基)-1- {[rel (2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-1H-1,2,4-三唑、(15.137) 2- [(2S,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.138) 2- [(2R,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.139) 2- [(2R,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.140) 2- [(2S,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.141) 2- [(2S,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.142) 2- [(2R,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.143) 2- [(2R,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.144) 2- [(2S,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.145) 2- 氟-6-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基) 苯甲酰胺、(15.146) 2-(6-苄基吡啶-2-基) 喹啉、(15.147) 2-[6-(3-氟-4-甲氧基苯基)-5-甲基吡啶-2-基] 喹啉、(15.148) 3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基) 喹啉、(15.149) 脱落酸 (abscisic acid)、(15.150) 3-(二氟甲基)-N-甲氧基-1-甲基-N-[1-(2,4,6-三氯苯基) 丙-2-基]-1H-吡啶-4-甲酰胺、(15.151) N'-[5-溴-6-(2,3-二氢-1H-茛-2-基氧基)-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.152) N'-{5-溴-6-[1-(3,5-二氟苯基) 乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.153) N'-{5-溴-6-[(1R)-1-(3,5-二氟苯基) 乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.154) N'-{5-溴-6-[(1S)-1-(3,5-二氟苯基) 乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.155) N'-{5-溴-6-[(顺式-4-异丙基环己基) 氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.156) N'-{5-溴-6-[(反式-4-异丙基环己基) 氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.157) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(15.158) N-环丙基-N-(2-环丙基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(15.159) N-(2-叔丁基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(15.160) N-(5-氯-2-乙基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(15.161) N-(5-氯-2-异丙基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(15.162) N-环

丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-氟苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.163) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(5-氟-2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.164) N-环丙基-N-(2-环丙基-5-氟苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.165) N-(2-环戊基-5-氟苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.166) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-氟-6-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.167) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.168) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基-5-甲基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.169) N-环丙基-N-(2-环丙基-5-甲基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.170) N-(2-叔丁基-5-甲基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.171) N-[5-氯-2-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.172) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-N-[5-甲基-2-(三氟甲基)苄基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.173) N-[2-氯-6-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.174) N-[3-氯-2-氟-6-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.175) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-4,5-二甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.176) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-硫代甲酰胺、(15.177) 3-(二氟甲基)-N-(7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.178) 3-(二氟甲基)-N-[(3R)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.179) 3-(二氟甲基)-N-[(3S)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.180) N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基苄基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.181) N'-{4-[(4,5-二氯-1,3-噁唑-2-基)氧基]-2,5-二甲基苄基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.182) N-(4-氯-2,6-二氟苄基)-4-(2-氯-4-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺。如果它们能够基于其官能团形成盐的话,则根据具体情况,在(1)至(15)类中所提及的所有混合组分可以与合适的碱或酸形成盐。

[0162] 作为混合组分的生物农药

[0163] 式(I)的化合物可与生物农药结合。

[0164] 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品,包括蛋白质和次级代谢物。

[0165] 生物农药包括细菌如产芽孢细菌(spore-forming bacteria)、根定殖细菌(root-colonizing bacteria)和用作生物杀昆虫剂、杀真菌剂或杀线虫剂的细菌。

[0166] 用作或可用作生物农药的这类细菌的实例为:

[0167] 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;或者坚强芽孢杆菌(*Bacillus firmus*),菌株I-1582(登录号CNCMI-1582);或短小芽孢杆菌(*Bacillus pumilus*),尤其是菌株GB34(登录号ATCC 700814)和菌株QST2808(登录号NRRL B-30087);或枯草芽孢杆菌(*Bacillus subtilis*),尤其是菌株GB03(登录号ATCC SD-1397),或枯草芽孢杆菌菌株QST713(登录号NRRL B-21661)或枯草芽孢杆菌菌株OST 30002(登录号NRRL B-50421);或苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*),尤其是苏云金杆菌以色列亚种(*B.thuringiensis subspecies israelensis*)(血清型H-14)、菌株AM65-52(登录号ATCC

1276),或苏云金杆菌鮎泽亚种(*B.thuringiensis* subsp.*aizawai*),尤其是菌株ABTS-1857(SD-1372),或苏云金杆菌库尔斯塔克亚种(*B.thuringiensis* subsp.*kurstaki*)菌株HD-1,或苏云金杆菌粉虫变种(*thuringiensis* subsp.*tenebrionis*)菌株NB 176(SD-5428);侵入巴斯德氏芽菌(*Pasteuria penetrans*),巴斯德芽菌属(*Pasteuriaspp.*) (肾形肾状线虫(*Rotylenchulus reniformis* nematode))-PR3(登录号ATCC SD-5834);细黄链霉菌(*Streptomyces microflavus*)菌株AQ6121(=QRD 31.013,NRRL B-50550);鲜黄链霉菌(*Streptomyces galbus*)菌株AQ 6047(登录号NRRL 30232)。

[0168] 用作或可用作生物农药的真菌和酵母菌的实例为:

[0169] 球孢白僵菌(*Beauveria bassiana*),尤其是菌株ATCC 74040,盾壳霉(*Coniothyrium minitans*),尤其是菌株CON/M/91-8(登录号DSM-9660);轮枝孢属(*Lecanicillium spp.*),尤其是菌株HR0 LEC 12,蜡蚧轮枝菌(*Lecanicillium lecanii*), (以前称为*Verticillium lecanii*),尤其是菌株KV01;金龟子绿僵菌(*Metarhizium anisopliae*),尤其是菌株F52(DSM3884/ATCC 90448);梅奇酵母菌(*Metschnikowia fructicola*),尤其是菌株NRRL Y-30752;玫烟色拟青霉(*Paecilomyces fumosoroseus*) (现名:玫烟色棒束孢(*Isaria fumosorosea*)),尤其是菌株IFPC 200613,或菌株Apopka 97(登录号ATCC 20874);淡紫拟青霉(*Paecilomyces lilacinus*),尤其是淡紫拟青霉菌株251(AGAL 89/030550);黄色蠕形霉(*Talaromyces flavus*),尤其是菌株V117b;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),尤其是菌株SC1(登录号CBS 122089);哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*),尤其是哈茨木霉T39(登录号CNCM I-952)。

[0170] 用作或可用作生物农药的病毒的实例为:

[0171] 棉褐带卷蛾(*Adoxophyes orana* (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))核型多角体病毒(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* (African cotton leafworm))NPV。

[0172] 还包括作为“接种剂”添加到植物或植物部位或植物器官中的细菌和真菌,这些细菌和真菌通过其特定性质促进植物生长和植物健康。实例包括:

[0173] 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.*)、伯克霍尔德氏菌属(*Burkholderia spp.*),尤其是洋葱伯克霍尔德菌(*Burkholderia cepacia*) (以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.*)、豆包菌(*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.*)、硬皮锈菌属(*Scleroderma spp.*)、乳牛肝菌属(*Suillus spp.*)、链霉菌属(*Streptomyces spp.*)。

[0174] 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品(包括蛋白和次级代谢产物)的实例为:



[0175] 大蒜(*Allium sativum*)、苦艾(*Artemisia absinthium*)、印楝素(*azadirachtin*)、Biokeeper WP、*Cassia nigricans*、苦皮藤(*Celastrus angulatus*)、*Chenopodium anthelminticum*、壳多糖(chitin)、Armour-Zen、鳞毛蕨(*Dryopteris filix-mas*)、问荆(*Equisetum arvense*)、Fortune Aza、Fungastop、Heads Up(奎奴亚藜(*Chenopodium quinoa*)皂苷提取物)、除虫菊/除虫菊酯类、苏里南苦木(*Quassia amara*)、栎树属(*Quercus*)、皂树属(*Quillaja*)、Regalia、“Requiem<sup>TM</sup>Insecticide”、鱼藤酮(rotenone)、鱼尼丁/兰尼碱、聚合草(*Symphytum officinale*)、艾菊(*Tanacetum vulgare*)、麝香草酚(thymol)、Triact 70、TriCon、旱金莲(*Tropaeolum majus*)、大荨麻(*Urtica dioica*)、Veratrin、槲寄生(*Viscum album*)、十字花科(*Brassicaceae*)提取物,特别是油籽油菜粉末或芥末粉末。

[0176] 作为混合组分的安全剂

[0177] 式(I)的化合物可与安全剂结合,例如解草酮(benoxacor)、喹氧乙酸(解草酯)(cloquintocet(-mexyl))、解草胺腈(cyometrinil)、环丙磺酰胺(cyprosulphamide)、二氯丙烯胺(dichlormid)、解草唑(fenchlorazole(-ethyl))、解草啉(fenclorim)、解草安(flurazole)、氟草肟(fluxofenim)、解草噁唑(furilazole)、双苯噁唑酸(乙酯)(isoxadifen(-ethyl))、吡唑解草酯(mefenpyr(-diethyl))、萘二甲酸酐(naphthalic anhydride)、解草腈(oxabetrinil)、2-甲氧基-N-{4-[(甲基氨基甲酰基)氨基]苯基}磺酰基)苯甲酰胺(CAS 129531-12-0)、4-(二氯乙酰基)-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷(CAS 71526-07-3)、2,2,5-三甲基-3-(二氯乙酰)-1,3-噁唑烷(CAS 52836-31-4)。

[0178] 植物和植物部位

[0179] 所有的植物和植物部位可根据本发明进行处理。在本文中植物理解为意指所有植物和植物种群,例如期望和不期望的野生植物或作物植物(包括天然存在的作物植物),例如谷类(小麦、水稻、黑小麦、大麦、黑麦、燕麦)、玉米、大豆、马铃薯、甜菜、甘蔗、番茄、豌豆和其他蔬菜物种、棉花、烟草、油菜以及果实植物(具有下述果实:苹果、梨、柑橘类果实和葡萄)。作物植物可以为通过常规的育种和优化方法或者通过生物技术方法和基因工程方法或这些方法的组合获得的植物,包括转基因植物以及包括受植物育种者的权利(plant breeders' right)保护或不受其保护的植物栽培种。植物部位应当理解为意指植物的地上和地下的所有部位和器官,如芽、叶、花和根,给出的实例为叶、针叶、茎、干、花、子实体、果实和种子、以及块茎、根和根茎。植物部位还包括采收的材料以及无性和有性繁殖的材料,例如插枝、块茎、根茎、分蘖(slip)和种子。

[0180] 根据本发明用式(I)的化合物对植物和植物部位进行的处理为直接进行的或通过常规处理方法使所述化合物作用于其环境、生境或储存空间来进行,例如通过浸渍、喷洒、蒸发、喷雾、撒播、涂抹、注射,以及在繁殖材料、尤其是种子的情况下,还可通过施用一层或多层包衣进行处理。

[0181] 如上所述,可根据本发明处理所有植物及其部位。在一个优选的实施方案中,处理了野生植物物种和植物栽培种、或那些通过常规生物育种如杂交或原生质体融合而获得的植物品种及其部位。在另一优选的实施方案中,处理了通过基因工程——如果合适的话可与常规方法结合——获得的转基因植物和植物栽培种(基因修饰生物)及其部位。术语“部位”或“植物的部位”或“植物部位”已在上文中解释。特别优选的是,可根据本发明处理相应

的市售常规栽培种或正在使用的那些植物。植物栽培种理解为意指具有新特性(“性状”)的并且其已通过常规育种、通过诱变或通过重组DNA技术获得。它们可以是栽培种、变种、生物型或基因型。

[0182] 转基因植物、种子处理和整合株系(integration events)

[0183] 根据本发明进行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植物)包括通过基因修饰接受了赋予这些植物特别有利的有用特性(“性状”)的基因材料的所有植物。这些特性的实例为:更好的植物生长、对高温或低温的增强的耐受性、对干旱或对水或土壤盐度水平的增强的耐受性、提高的开花性能、更容易采收、加速成熟、采收产品的更高的产量、更高的品质和/或更高的营养价值、采收产品的更好的储存期和/或可加工性。这些特性的其他和特别强调的实例为,增强植物对动物和微生物有害物例如昆虫、蛛形纲动物、线虫、螨虫、蛞蝓以及蜗牛的抗性,其归因于例如在植物中生成的毒素、特别是通过苏云金芽孢杆菌的基因材料(例如通过基因CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb和CryIF及其组合)在植物中形成的那些毒素;以及增强植物对植物病原性真菌、细菌和/或病毒的抗性,其归因于例如系统获得性抗性(SAR)、系统素、植物抗毒素、诱导子和抗性基因以及相应的表达蛋白和毒素;以及提高植物对特定除草活性化合物的耐受性,例如对咪唑啉酮类、磺酰脲类、草甘膦或草丁膦(例如“PAT”基因)。赋予了所讨论的所需特性(“性状”)的基因还可在转基因植物中以与互相结合的形式存在。转基因植物的实例包括重要的作物植物,例如谷类(小麦、水稻、黑小麦、大麦、黑麦、燕麦)、玉米、大豆、马铃薯、甜菜、甘蔗、番茄、豌豆和其他类型的蔬菜、棉花、烟草、油菜以及果实植物(具有下述果实:苹果、梨、柑橘类果实和葡萄藤),特别强调的是玉米、大豆、小麦、水稻、马铃薯、棉花、甘蔗、烟草和油菜。特别强调的特性(“性状”)是增强植物对昆虫、蛛形纲动物、线虫以及蛞蝓和蜗牛的抗性。

[0184] 作物保护——处理类型

[0185] 用式(I)的化合物对植物和植物部位进行的处理为直接进行的或通过使所述化合物作用于其环境、生境或储存空间使用常规处理方法来进行,例如通过浸渍、喷洒、喷雾、灌溉、蒸发、撒粉、雾化、撒播、发泡、涂抹、撒布、注射、浇水(浇灌)、滴灌,以及在繁殖材料、尤其是种子的情况下,还以作为用于干种子处理的粉末、用于液体种子处理的溶液、用于浆液处理的水溶性粉末,通过结壳、通过用一层或多层包衣包覆等方法进行处理。还可以通过超低容量方法施用式(I)的化合物或者将其施用形式或式(I)的化合物本身注射到土壤中。

[0186] 一种优选的对植物的直接处理为叶面施用,即将式(I)的化合物施用到叶面上,其中处理频率和施用率应根据所述有害物的侵染水平来调整。

[0187] 在系统活性化合物的情况下,式(I)的化合物还可以经由根体系进入植物。然后,通过将式(I)的化合物作用于植物的生境来处理该植物。这可以通过例如下述方式完成:浇灌;或者通过混入土壤或营养液中,这意味着植物位点(例如土壤或水培系统)被液体形式的式(I)的化合物浸渍;或通过土壤施用,这意味着将式(I)的化合物以固体形式(例如以颗粒的形式)引入到植物位点。在水稻作物的情况下,其还可以通过将式(I)的化合物以固体施用形式(例如作为颗粒)计量加入淹没的稻田来完成。

[0188] 种子处理

[0189] 通过对植物种子进行处理来防治动物有害物早已已知并且是不断改进的主题。然

而,种子处理涉及一系列始终不能以令人满意的方式解决的问题。因此,需要开发用于保护种子和发芽作物的方法,该方法不需要或至少显著降低在储存过程中、在播种后或植物出苗后额外施用农药。此外还需要优化所使用的活性化合物的量,以便为种子和发芽植物提供最佳的保护免受动物有害物的侵害,而所使用的活性化合物则不会损害植物本身。特别地,用于种子处理的方法还应考虑到有害物抗性或有害物耐受性的转基因植物的固有的杀昆虫和/或杀线虫特性,以便以最少的农药消耗实现对种子和发芽植物的最佳保护。

[0190] 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害的方法。本发明用于保护种子和发芽植物免受有害物侵害的方法还包括在一个操作中同时或依序用式(I)的化合物和混合组分处理种子的方法。其还包括在不同的时间用式(I)的化合物和混合组分处理种子的方法。

[0191] 本发明同样涉及式(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有害物侵害的用途。

[0192] 本发明还涉及用式(I)的化合物处理过以保护其免受动物有害物侵害的种子。本发明还涉及用式(I)的化合物和混合组分同时处理过的种子。本发明还涉及用式(I)的化合物和混合组分在不同时间处理过的种子。在用式(I)的化合物和混合组分在不同时间处理过的种子的情况下,各物质可存在于该种子的不同层上。在这种情况下,包含式(I)的化合物和混合组分的层可以任选地被中间层隔开。本发明还涉及其中已经施用了作为包衣的一部分或除了包衣外的其他一层或其他几层的式(I)的化合物和混合组分的种子。

[0193] 本发明还涉及在用式(I)的化合物处理后进行涂膜过程以防止该种子遭受灰尘磨损的种子。

[0194] 当式(I)的化合物系统性地作用时,存在的优势之一在于,通过种子处理不仅保护种子本身还保护由其得到的植物在出苗后免受动物有害物的侵害。以这种方式,无需在播种时或在其后不久对作物立刻进行处理。

[0195] 另一个优势在于,用式(I)的化合物处理种子可促进经处理的种子发芽和出苗。

[0196] 同样认为有利的是,式(I)的化合物还可尤其用于转基因种子。

[0197] 此外,式(I)的化合物可与信号技术的组分或化合物结合使用,其结果是,例如,使共生体(例如根瘤菌、菌根和/或内生细菌或真菌)的定殖(colonization)更好,和/或优化固氮作用。

[0198] 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,其包括谷物(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、油菜、甜菜(例如糖用甜菜和饲用甜菜)、花生、蔬菜(例如番茄、黄瓜、菜豆、十字花科蔬菜、洋葱和莴苣)、果实植物、草坪植物和观赏性植物的种子。特别重要的是处理谷物(小麦、大麦、黑麦、燕麦)、玉米、大豆、棉花、加拿大油菜、油菜和稻的种子。

[0199] 如上所述,用式(I)的化合物处理转基因种子也是特别重要的。其包括通常包含至少一种控制特别是具有杀昆虫和/或杀线虫特性的多肽的表达的异源基因的植物的种子。转基因种子中的异源基因可来自微生物如芽孢杆菌属(*Bacillus*)、根瘤菌属(*Rhizobium*)、假单胞菌属(*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*)。本发明特别适合用于处理

包含至少一种源自芽孢杆菌属的异源基因的转基因种子。所述异源基因更优选源自苏云金芽孢杆菌 (*Bacillus thuringiensis*)。

[0200] 在本发明的上下文中,将式 (I) 的化合物施用于种子。优选在这样的状态下处理种子:其足够稳定以使得在处理过程中不发生损害。一般而言,种子可在采收和播种之间的任意时间点处理。通常使用已从植物分离并且已除去穗轴、壳、茎、荚、毛或果肉的种子。因此,例如,可使用已采收、清洁并干燥至允许贮存的水分含量的种子。或者,也可使用在干燥之后例如再经水处理,然后再经干燥(例如priming)的种子。

[0201] 在处理种子时,通常必须确保对施用于种子的式 (I) 的化合物的量和/或其他添加剂的量的选择为使得种子的发芽不会受到不利影响,或者所得植物不会受到损害。在某些施用率下可表现出植物毒性效应的活性化合物的情况下,这必须特别保证。

[0202] 通常,式 (I) 的化合物以合适的制剂形式施用于种子。合适的制剂和种子处理方法是本领域技术人员已知的。

[0203] 式 (I) 的化合物可转化为常规拌种制剂,例如溶液剂、乳剂、悬液剂、粉剂、泡沫剂、浆剂或其他用于种子的包衣组合物,以及ULV制剂。

[0204] 这些制剂以已知的方式通过将式 (I) 的化合物与常规添加剂混合而制备,所述添加剂为例如常规的增量剂以及溶剂或稀释剂、染料、湿润剂、分散剂、乳化剂、消泡剂、防腐剂、二次增稠剂、粘合剂、赤霉素以及水。

[0205] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的染料为通常用于此目的的所有染料。可以使用微溶于水的颜料,或者也可使用可溶于水的染料。实例包括已知的名称为罗丹明B (Rhodamine B)、C.I. 颜料红112和C.I. 溶剂红1的染料。

[0206] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的有用的润湿剂为促进润湿并且通常用于活性农用化学化合物制剂的所有物质。优选使用烷基萘磺酸盐,例如二异丙基萘磺酸盐或二异丁基萘磺酸盐。

[0207] 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活性农用化学化合物制剂中的所有非离子、阴离子和阳离子分散剂。优选使用非离子或阴离子分散剂或者非离子或阴离子分散剂的混合物。合适的非离子分散剂特别包括环氧乙烷/环氧丙烷嵌段共聚物、烷基酚聚乙二醇醚和三苯乙烯基酚聚乙二醇醚、以及其磷酸化或硫酸化衍生物。合适的阴离子分散剂尤其是木素磺酸盐、聚丙烯酸盐、以及芳基磺酸盐/甲醛的缩合物。

[0208] 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活性农用化学化合物制剂中的所有泡沫抑制剂。可优选使用硅酮消泡剂和硬脂酸镁。

[0209] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的防腐剂为在农用化学组合物中可用于此目的的所有物质。实例包括二氯酚和苯甲醇半缩甲醛。

[0210] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的二次增稠剂为可在活性农用化学组合物中用于此目的的所有物质。优选的实例包括纤维素衍生物、丙烯酸衍生物、黄原胶、改性粘土和细分散的二氧化硅。

[0211] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的有用的粘合剂为可在拌种产品中使用的所有常规粘合剂。优选的实例包括聚乙烯吡咯烷酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇和纤维素乙酸钠 (tylose)。

[0212] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的赤霉素优选为赤霉素A1、A3(=赤霉酸)、A4和A7,特别优选使用赤霉酸。所述赤霉素是已知的(参见R.Wegle“Chemie der Pflanzenschutz-und **Schädlingsbekämpfungsmittel**”, vol.2, Springer Verlag, 1970, pp.401-412)。

[0213] 可根据本发明使用的拌种制剂可以直接或预先用水稀释后用于处理各种不同种类种子。例如,可使用浓缩剂或通过用水稀释而由其得到的制剂用于对下列种子进行拌种:谷物(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、豆、棉花、向日葵、大豆和甜菜的种子,或各种不同的蔬菜种子。可根据本发明使用的拌种制剂或其稀释使用形式还可用于拌种转基因植物的种子。

[0214] 对于用可根据本发明使用的拌种制剂或由其制备的使用形式处理种子而言,所有可常规用于种子拌种的混合设备均为可用的。更具体地,种子拌种的过程为:将种子分批或连续地置于混合器中;以其本身或预先用水稀释之后,加入特定所需量的拌种制剂;并进行混合直到制剂均匀分布于种子上。如果合适的话,随后可进行干燥操作。

[0215] 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。其取决于该制剂中式(I)的化合物的具体含量以及种子。式(I)的化合物的施用率通常为每千克种子0.001g至50g;优选每千克种子0.01g至15g。

[0216] 动物健康

[0217] 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具有活性,尤其是体外寄生虫或体内寄生虫。术语“体内寄生虫”尤其包括蠕虫;以及原生动动物,如球虫。体外寄生虫通常且优选为节肢动物,尤其是昆虫和螨。

[0218] 在兽医学领域中,具有有利的恒温动物毒性的式(I)的化合物适合用于防治寄生虫,所述寄生虫出现在牲畜、育种动物、动物园动物、实验室动物、实验动物和家养动物中的动物育种和动物饲养中。它们对寄生虫发育的所有或特定阶段具有活性。

[0219] 农业牲畜包括,例如,哺乳动物,如绵羊、山羊、马、驴、骆驼、水牛、兔、驯鹿、扁角鹿(fallow deer),且特别是牛和猪;家禽,如火鸡、鸭、鹅,且特别是鸡;例如水产养殖中的鱼和甲壳类动物;以及昆虫如蜜蜂。

[0220] 家养动物包括,例如,哺乳动物,如仓鼠、豚鼠、大鼠、小鼠、毛丝鼠、雪貂,特别是狗、猫、笼养鸟、爬行动物、两栖动物和观赏鱼。

[0221] 在一个优选的实施方案中,式(I)的化合物给药于哺乳动物。

[0222] 在另一优选的实施方案中,式(I)的化合物给药于禽类,即笼养鸟且特别是家禽。

[0223] 使用式(I)的化合物来防治动物寄生虫旨在减少或预防疾病、死亡和性能降低(在肉、奶、羊毛、生皮、蛋、蜜等情况下)的情况,以使得动物畜牧业能够更经济和更简单,并且实现更好地保持动物良好的状态。

[0224] 关于动物健康领域,术语“防治(control)”或“防治(controlling)”意指式(I)的化合物在将特定的寄生虫在感染这类寄生虫的动物中的发病率降低至无害程度方面是有效的。更具体而言,在本上下文中,“防治”意指式(I)的化合物能杀死各寄生虫、抑制其生长或抑制其增殖。

[0225] 节肢动物包括:

[0226] 虱目(Anoplurida)的节肢动物,例如血虱属(Haematopinus spp.)、颚虱属

(*Linognathus* spp.)、人虱属(*Pediculus* spp.)、阴虱属(*Phtirus*spp.)、管虱属(*Solenopotes* spp.)；食毛目(Mallophagida)及纯角亚目(*Amblycerina*)和细角亚目(*Ischnocerina*)的节肢动物,例如毛羽虱属(*Trimenopon* spp.)、禽虱属(*Menopon* spp.)、巨羽虱属(*Trinoton* spp.)、牛羽虱属(*Bovicola* spp.)、*Werneckiella* spp.、*Lepikentron* spp.、畜虱属(*Damalina* spp.)、啮毛虱属(*Trichodectes* spp.)、猫羽虱属(*Felicola* spp.)；双翅目(Diptera)及长角亚目(*Nematocerina*)和短角亚目(*Brachycerina*)的节肢动物,例如伊蚊属(*Aedes* spp.)、按蚊属(*Anopheles* spp.)、库蚊属(*Culex* spp.)、蚋属(*Simulium* spp.)、真蚋属(*Eusimulium* spp.)、白蛉属(*Phlebotomus* spp.)、罗蛉属(*Lutzomyia* spp.)、库蠓属(*Culicoides* spp.)、斑虻属(*Chrysops* spp.)、短蚋属(*Odagmia* spp.)、维蚋属(*Wilhelmia* spp.)、瘤虻属(*Hybomitra* spp.)、黄虻属(*Atylotus* spp.)、虻属(*Tabanus* spp.)、麻虻属(*Haematopota* spp.)、*Philipomyia* spp.、蜂虱蝇属(*Braula* spp.)、家蝇属(*Musca* spp.)、齿股蝇属(*Hydrotaea* spp.)、螫蝇属(*Stomoxys* spp.)、黑角蝇属(*Haematobia* spp.)、莫蝇属(*Morellia* spp.)、厕蝇属(*Fannia* spp.)、舌蝇属(*Glossina* spp.)、丽蝇属(*Calliphora* spp.)、绿蝇属(*Lucilia* spp.)、金蝇属(*Chrysomya* spp.)、污蝇属(*Wohlfahrtia* spp.)、麻蝇属(*Sarcophaga* spp.)、狂蝇属(*Oestrus* spp.)、皮蝇属(*Hypoderma* spp.)、胃蝇属(*Gasterophilus* spp.)、虱蝇属(*Hippobosca* spp.)、羊虱蝇属(*Lipoptena* spp.)、蜉蝇属(*Melophagus* spp.)、鼻狂蝇属(*Rhinoestrus* spp.)、大蚊属(*Tipula* spp.)；蚤目(Siphonapterida)的节肢动物,例如蚤属(*Pulex* spp.)、栉头蚤属(*Ctenocephalides* spp.)、潜蚤属(*Tunga* spp.)、客蚤属(*Xenopsylla* spp.)、角叶蚤属(*Ceratophyllus* spp.)；

[0227] 半翅目(Heteropterida)的节肢动物,例如臭虫属(*Cimex* spp.)、锥猎蝽属(*Triatoma* spp.)、红猎蝽属(*Rhodnius* spp.)、大锥蝽属(*Panstrongylus* spp.)；以及蜚蠊目(Blattarida)的公害有害物和卫生有害物。

[0228] 节肢动物还包括：

[0229] 蜱螨(Acari(Acarina))亚纲及后气门目(Metastigmata)的节肢动物,例如软蜱科(Argasidae),如锐缘蜱属(*Argas* spp.)、钝缘蜱属(*Ornithodoros* spp.)、硬蜱科(Ixodidae),如残缘蜱属(*Otobius* spp.)、硬蜱属(*Ixodes* spp.)、花蜱属(*Amblyomma* spp.)、牛蜱属(*Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp.)、革蜱属(*Dermacentor* spp.)、血蜱属(*Haemophysalis* spp.)、璃眼蜱属(*Hyalomma* spp.)、皮刺蜱属(*Dermanyssus* spp.)、扇头蜱属(*Rhipicephalus* spp.) (多宿主蜱的原属)；中气门目(Mesostigmata)的节肢动物,如刺皮蜱属(*Dermanyssus* spp.)、禽刺蜱属(*Ornithonyssus* spp.)、肺刺蜱属(*Pneumonyssus* spp.)、耳蜱属(*Raillietia* spp.)、肺刺蜱属(*Pneumonyssus* spp.)、气囊蜱属(*Sternostoma* spp.)、蜂蜱属(*Varroa* spp.)、蜂盾蜱属(*Acarapis* spp.)；辐螨目(Actinedida) (前气门亚目(Prostigmata))的节肢动物,例如蜂盾蜱属(*Acarapis* spp.)、姬螯螨属(*Cheyletiella* spp.)、禽螯螨属(*Ornithocheyletia* spp.)、肉螨属(*Myobia* spp.)、疮螨属(*Psorergates* spp.)、蠕形螨属(*Demodex* spp.)、恙螨属(*Trombicula* spp.)、*Neotrombicula* spp.、兔牦螨属(*Listrophorus* spp.)；以及粉螨目(Acaridida) (无气门亚目(Astigmata))的节肢动物,例如粉螨属(*Acarus* spp.)、腐食螨属(*Tyrophagus* spp.)、嗜木螨属(*Caloglyphus* spp.)、大脚颈下螨属(*Hypodectes* spp.)、羽毛螨属

(*Pterolichus* spp.)、痒螨属(*Psoroptes* spp.)、皮螨属(*Chorioptes* spp.)、耳疥螨属(*Otodectes* spp.)、疥螨属(*Sarcoptes* spp.)、背肛螨属(*Notoedres* spp.)、鸟疥螨属(*Knemidocoptes* spp.)、胞螨属(*Cytodites* spp.)、鸡雏螨属(*Laminosioptes* spp.)。

[0230] 寄生原生动物包括:

[0231] 鞭毛纲(*Mastigophora*、鞭毛虫纲(*Flagellata*)), 例如锥虫科(*Trypanosomatidae*), 例如布鲁斯锥虫(*Trypanosoma b. brucei*)、冈比亚锥虫(*T. b. gambiense*)、罗德西亚锥虫(*T. b. rhodesiense*)、刚果锥虫(*T. congolense*)、克氏锥虫(*T. cruzi*)、伊氏锥虫(*T. evansi*)、马锥虫(*T. equinum*)、路氏锥虫(*T. lewisi*)、*T. percae*、猿猴锥虫(*T. simiae*)、活跃锥虫(*T. vivax*)、巴西利什曼原虫(*Leishmania brasiliensis*)、杜氏利什曼原虫(*L. donovani*)、热带利什曼原虫(*L. tropica*), 例如毛滴虫科(*Trichomonadidae*), 例如兰伯贾第虫(*Giardia lamblia*)、犬贾第虫(*G. canis*);

[0232] 肉鞭虫门(*Sarcomastigophora*、根足总纲(*Rhizopoda*)), 例如内阿米巴科(*Entamoebidae*), 例如溶组织内阿米巴(*Entamoeba histolytica*)、*Hartmannellidae*, 例如棘阿米巴属(*Acanthamoeba* sp.)、*Harmanella* sp.;

[0233] 顶复门(*Apicomplexa*、孢子虫亚门(*Sporozoa*)), 例如艾美球虫属(*Eimeridae*), 例如堆形艾美球虫(*Eimeria acervulina*)、*E. adenoides*、阿拉巴艾美球虫(*E. alabamensis*)、鸭艾美球虫(*E. anatis*)、鹅包柔氏艾美球虫(*E. anserina*)、阿氏艾美球虫(*E. arloingi*)、*E. ashata*、奥博伦艾美球虫(*E. auburnensis*)、牛艾美球虫(*E. bovis*)、牛艾美球虫(*E. brunetti*)、犬艾美球虫(*E. canis*)、*E. chinchillae*、*E. clupearum*、鸽艾美球虫(*E. columbae*)、*E. contorta*、*E. crandalis*、狄氏艾美球虫(*E. deblickei*)、分散艾美球虫(*E. dispersa*)、*E. ellipsoidales*、镰形艾美球虫(*E. falciiformis*)、福氏艾美球虫(*E. faurei*)、黄色艾美球虫(*E. flavescens*)、加洛帕沃尼艾美球虫(*E. gallopavonis*)、哈氏艾美球虫(*E. hagani*)、肠艾美球虫(*E. intestinalis*)、*E. iroquoina*、无残艾美球虫(*E. irresidua*)、唇艾美球虫(*E. labbeana*)、*E. leucarti*、大型艾美球虫(*E. magna*)、巨型艾美球虫(*E. maxima*)、中等艾美球虫(*E. media*)、珠鸡艾美球虫(*E. meleagridis*)、珠鸡和缓米堤艾美球虫(*E. meleagritidis*)、和缓艾美球虫(*E. mitis*)、毒害艾美球虫(*E. necatrix*)、山羊艾美球虫(*E. ninakohlyakimovae*)、羊艾美球虫(*E. ovis*)、小型艾美球虫(*E. parva*)、孔雀艾美球虫(*E. pavonis*)、有孔艾美球虫(*E. perforans*)、*E. phasani*、梨形艾美球虫(*E. piriformis*)、早熟艾美球虫(*E. praecox*)、*E. residua*、粗糙艾美球虫(*E. scabra*)、艾美球虫属(*E. spec.*)、斯氏艾美球虫(*E. stiedai*)、猪艾美球虫(*E. suis*)、禽艾美球虫(*E. tenella*)、树艾美球虫(*E. truncata*)、特鲁特艾美球虫(*E. truttae*)、朱氏艾美球虫(*E. zuernii*)、球形虫属(*Globidium spec.*)、贝氏等孢子球虫(*Isospora belli*)、犬等孢子球虫(*I. canis*)、猫等孢子球虫(*I. felis*)、俄亥俄等孢子球虫(*I. ohioensis*)、犬等孢子球虫(*I. rivolta*)、等孢子球虫属(*I. spec.*)、猪等孢子球虫(*I. suis*)、*Cystisopora spec.*、隐孢子虫属(*Cryptosporidium spec.*)、尤其小隐孢子虫(*C. parvum*); 例如>Toxoplasmatidae, 例如弓形虫属(*Toxoplasma gondii*)、*Hammondia heydornii*、新孢子虫属(*Neospora caninum*)、*Besnoitia besnoitii*; 例如肉孢子虫科(*Sarcocystidae*), 例如牛猫肉孢子虫(*Sarcocystis bovicanis*)、牛人肉孢子虫(*S. bovi hominis*)、*S. ovicanis*、*S. ovifelis*、*S. neurona*、肉孢子虫属(*S. spec.*)、猪-人肉孢子虫(*S. sui hominis*), 例如

Leucozoidae,例如Leucozytozoon simondi,例如疟原虫科(Plasmodiidae)、例如伯氏疟原虫(Plasmodium berghei)、P.falciparum、P.malariae、蛋形疟原虫(P.ovale)、P.vivax、疟原虫属(P.spec.),例如梨质纲(Piroplasma),例如阿根廷巴贝虫(Babesia argentina)、牛巴贝虫(B.bovis)、B.canis、巴贝虫属(B.spec.),小泰勒虫(Theileria parva)、泰勒虫属(Theileria spec.),例如匿虫亚目(Adeleina),例如犬肝簇虫(Hepatozoon canis)、肝簇虫属(H.spec.)。

[0234] 病原性体内寄生虫,其为蠕虫,包括扁形动物(Platyhelmintha)(例如单殖亚纲(Monogenea)、绦虫类(cestodes)和吸虫类(trematodes)、线虫动物(roundworms)、棘头虫纲(Acanthocephala)和舌形虫属(Pentastoma)。其包括:

[0235] 单殖亚纲:例如:三代虫属(Gyrodactylus spp.)、指环虫属(Dactylogyrus spp.)、多盘吸虫属(Polystoma spp.);

[0236] 绦虫类:假叶目(Pseudophyllidea)的绦虫,例如:裂头属(Diphyllobothrium spp.)、迭宫绦虫属(Spirometra spp.)、Schistocephalus spp.、舌状绦虫属(Ligula spp.)、Bothridium spp.、复殖孔绦虫属(Diplogonoporus spp.);

[0237] Cyclophyllida目的绦虫,例如:中殖孔绦虫属(Mesocestoides spp.)、裸头绦虫属(Anoplocephala spp.)、副裸头绦虫属(Paranoplocephala spp.)、蒙尼茨绦虫属(Moniezia spp.)、縋体绦虫属(Thysanosoma spp.)、曲子宫绦虫属(Thysaniezia spp.)、无卵黄腺绦虫属(Avitellina spp.)、Stilesia spp.、裸头绦虫属(Cittotaenia spp.)、Andyra spp.、伯特绦虫属(Bertiella spp.)、绦虫属(Taenia spp.)、棘球属(Echinococcus spp.)、泡尾绦虫属(Hydatigera spp.)、代凡绦虫属(Davainea spp.)、瑞列绦虫属(Raillietina spp.)、膜壳绦虫属(Hymenolepis spp.)、棘鳞绦虫属(Echinolepis spp.)、Echinocotyle spp.、双睾属(Diorchis spp.)、复孔绦虫属(Dipylidium spp.)、复孔绦虫属(Joyeuxiella spp.)、复孔绦虫属(Diplopylidium spp.);

[0238] 吸虫类:复殖目(Digenea)的吸虫,例如:双穴吸虫属(Diplostomum spp.)、茎穴吸虫属(Posthodiplostomum spp.)、血吸虫属(Schistosoma spp.)、毛毕吸虫属(Trichobilharzia spp.)、鸟毕吸虫属(Ornithobilharzia spp.)、澳毕吸虫属(Austroilharzia spp.)、巨毕吸虫属(Gigantobilharzia spp.)、彩蚴属(Leucochloridium spp.)、Brachylaima spp.、棘口吸虫属(Echinostoma spp.)、棘缘吸虫属(Echinoparyphium spp.)、棘隙吸虫属(Echinochasmus spp.)、Hypoderaeum spp.、片形属(Fasciola spp.)、Fasciolides spp.、姜片属(Fasciolopsis spp.)、环腔属(Cyclocoelum spp.)、盲腔吸虫属(Typhlocoelum spp.)、同端盘属(Paramphistomum spp.)、杯殖吸虫属(Calicophoron spp.)、殖盘吸虫属(Cotylophoron spp.)、巨孔吸虫属(Gigantocotyle spp.)、Fischoederius spp.、Gastrothylacus spp.、背孔吸虫属(Notocotylus spp.)、下弯吸虫属(Catatropis spp.)、斜睾吸虫属(Plagiorchis spp.)、前殖吸虫属(Prosthogonimus spp.)、双腔吸虫属(Dicrocoelium spp.)、阔盘吸虫属(Eurytrema spp.)、隐孔吸虫属(Troglootrema spp.)、并殖吸虫属(Paragonimus spp.)、Collyriclum spp.、侏形吸虫属(Nanophyetus spp.)、后睾属(Opisthorchis spp.)、支睾吸虫属(Clonorchis spp.)、次睾吸虫属(Metorchis spp.)、异形吸虫属(Heterophyes



spp.)、后殖吸虫属(*Metagonimus* spp.)；

[0239] 线虫动物: *Trichinellida*, 例如: 鞭虫属(*Trichuris* spp.)、毛细线虫属(*Capillaria* spp.)、*Paracapillaria* spp.、*Eucoleus* spp.、*Trichomosoides* spp.、毛线虫属(*Trichinella* spp.)；

[0240] 垫刃目(*Tylenchida*)的线虫动物, 例如: 微线虫属(*Micronema* spp.)、类圆线虫属(*Strongyloides* spp.)；

[0241] 杆线虫目(*Rhabditida*)的线虫动物, 例如: 圆线虫属(*Strongylus* spp.)、三齿线虫属(*Triodontophorus* spp.)、食管齿属(*Oesophagodontus* spp.)、毛线线虫属(*Trichonema* spp.)、辐首线虫属(*Gyalocephalus* spp.)、*Cylindropharynx* spp.、杯口线虫属(*Poteriostomum* spp.)、*Cyclococercus* spp.、杯冠属(*Cylicostephanus* spp.)、结节线虫属(*Oesophagostomum* spp.)、夏柏特线虫属(*Chabertia* spp.)、冠尾线属(*Stephanurus* spp.)、钩口线虫属(*Ancylostoma* spp.)、钩虫属(*Uncinaria* spp.)、板口线虫属(*Necator* spp.)、仰口线虫属(*Bunostomum* spp.)、球头线虫属(*Globocephalus* spp.)、鸡张口丝虫属(*Syngamus* spp.)、杯口属(*Cyathostoma* spp.)、后圆线虫属(*Metastrongylus* spp.)、网尾线虫属(*Dictyocaulus* spp.)、缪勒线虫属(*Muellerius* spp.)、原圆线虫属(*Protostrongylus* spp.)、原圆线虫属(*Neoststrongylus* spp.)、囊尾属(*Cystocaulus* spp.)、肺圆虫属(*Pneumoststrongylus* spp.)、*Spicocaulus* spp.、麋圆线虫属(*Elaphoststrongylus* spp.)、拟马鹿圆线虫属(*Parelaphoststrongylus* spp.)、环体线虫属(*Crenosoma* spp.)、*Paracrenosoma* spp.、*Oslerus* spp.、管圆线虫属(*Angiostrongylus* spp.)、猫圆线虫属(*Aelurostrongylus* spp.)、丝状虫属(*Filaroides* spp.)、副类丝虫属(*Parafilaroides* spp.)、毛圆线虫属(*Trichostrongylus* spp.)、血矛线虫属(*Haemonchus* spp.)、胃线虫属(*Ostertagia* spp.)、背带线虫属(*Teladorsagia* spp.)、马歇尔线虫属(*Marshallagia* spp.)、古柏线虫属(*Cooperia* spp.)、日本圆线虫属(*Nippostrongylus* spp.)、*Heligmosomoides* spp.、细颈线虫属(*Nematodirus* spp.)、猪圆形属(*Hyostrongylus* spp.)、尖柱线虫属(*Obeliscoides* spp.)、裂口线虫属(*Amidostomum* spp.)、沃鲁线虫属(*Ollulanus* spp.)；

[0242] 旋尾目(*Spirurida*)的线虫动物, 例如: 尖尾线虫属(*Oxyuris* spp.)、蛲虫属(*Enterobius* spp.)、栓尾线虫属(*Passalurus* spp.)、管状线虫属(*Syphacia* spp.)、无刺线虫属(*Aspicularis* spp.)、异刺线虫属(*Heterakis* spp.)；蛔虫属(*Ascaris* spp.)、弓蛔线虫属(*Toxascaris* spp.)、弓蛔虫属(*Toxocara* spp.)、贝利蛔线虫属(*Baylisascaris* spp.)、副蛔虫属(*Parascaris* spp.)、异尖属(*Anisakis* spp.)、异尖属(*Ascaridia* spp.)；颚口线虫属(*Gnathostoma* spp.)、泡翼属线虫属(*Physaloptera* spp.)、吸吮线虫属(*Thelazia* spp.)、筒线属(*Gongylonema* spp.)、丽线虫属(*Habronema* spp.)、*Parabronema* spp.、德拉西线虫属(*Draschia* spp.)、龙线虫属(*Draunculus* spp.)；冠丝虫属(*Stephanofilaria* spp.)、副丝虫属(*Parafilaria* spp.)、腹腔丝虫属(*Setaria* spp.)、罗阿丝虫属(*Loa* spp.)、恶丝虫属(*Dirofilaria* spp.)、光丝虫属(*Litomosoides* spp.)、布鲁丝虫属(*Brugia* spp.)、吴策线虫属(*Wuchereria* spp.)、盘尾丝虫属(*Onchocerca* spp.)、旋毛线虫属(*Spirocerca* spp.)；

[0243] 棘头虫纲(*Acanthocephala*): 少棘目(*Oligacanthorhynchida*), 例如: 巨吻棘头虫

属 (*Macracanthorhynchus* spp.)、前睾棘头虫属 (*Prosthenorchis* spp.); Polymorphida, 例如: 细颈棘头虫属 (*Filicollis* spp.); Moniliformida, 例如: 念珠棘虫属 (*Moniliformis* spp.);

[0244] Echinorhynchida, 例如: 棘头虫属 (*Acanthocephalus* spp.)、钩头虫属 (*Echinorhynchus* spp.)、似细吻棘头虫属 (*Leptorhynchoides* spp.);

[0245] 舌形虫属 (*Pentastoma*): 蛇舌状虫目 (*Porocephalida*) 的舌形虫属, 例如舌形虫属 (*Linguatula* spp.)。

[0246] 在兽医领域和动物饲养中, 通过本领域中通常已知的方法给药式 (I) 的化合物, 例如以合适的制剂形式经由肠内、肠胃外、皮肤或鼻途径给药。给药可以是预防性的或治疗性的。

[0247] 因此, 本发明的一个实施方案是指式 (I) 的化合物作为药物的用途。

[0248] 另一方面涉及式 (I) 的化合物作为抗体内寄生虫剂, 尤其是作为驱虫剂或抗原生动物剂的用途。式 (I) 的化合物适合例如在动物畜牧业中、在动物育种中、在牲畜的房屋中和在卫生领域中用作抗体内寄生虫剂, 尤其是用作驱虫剂或抗原生动物剂。

[0249] 相应地, 另一方面涉及式 (I) 的化合物作为抗体外寄生虫剂, 尤其是杀节肢动物剂 (例如杀昆虫剂或杀螨剂) 的用途。另一方面涉及式 (I) 的化合物例如在动物畜牧业中、在动物育种中、在牲畜的房屋中或在卫生领域中作为抗体外寄生虫剂, 尤其是杀节肢动物剂 (例如杀昆虫剂或杀螨剂) 的用途。

[0250] 病媒防治

[0251] 式 (I) 的化合物还可用于病媒防治。在本发明的上下文中, 病媒为节肢动物, 尤其是昆虫或蛛形纲动物, 其能够将病原体例如病毒、蠕虫、单细胞生物和细菌, 从贮主 (植物、动物、人等) 传播至宿主中。所述病原体可以机械地传播至宿主 (例如通过无刺蝇 (non-stinging) 传播沙眼), 或者可以在注射后传播至宿主 (例如通过蚊子传播疟原虫)。

[0252] 病媒以及它们传播的疾病或病原体的实例为:

[0253] 1) 蚊 (*Mosquitoes*)

[0254] -按蚊属: 疟疾、丝虫病;

[0255] -库蚊属: 日本脑炎、丝虫病、其他病毒性疾病、蠕虫传播;

[0256] -伊蚊属: 黄热病、登革热、丝虫病、其他病毒性疾病;

[0257] -蚋科: 蠕虫传播, 特别是盘尾丝虫 (*Onchocerca volvulus*);

[0258] 2) 虱: 皮肤感染、流行性斑疹伤寒 (epidemic typhus);

[0259] 3) 跳蚤: 鼠疫、地方性斑疹伤寒;

[0260] 4) 蝇: 昏睡病 (锥虫病 (trypanosomiasis))、霍乱、其他细菌性疾病;

[0261] 5) 螨: 壁虱病、流行性斑疹伤寒、立克次氏体痘、土拉菌病、圣路易斯脑炎 (*Saint Louis encephalitis*)、蜱媒脑炎 (tick-borne encephalitis) (TBE)、克里米亚-刚果出血热 (*Crimean-Congo haemorrhagic fever*)、疏螺旋体病 (*borreliosis*);

[0262] 6) 蜱: *borellioses*, 如达氏疏螺旋体 (*Borrelia duttoni*)、蜱媒脑炎、Q热 (贝氏柯克斯体 (*Coxiella burnetii*))、焦虫病 (*babesioses*) (犬巴贝斯虫 (*Babesia canis canis*))。

[0263] 在本发明的上下文中, 病媒的实例为昆虫, 例如蚜虫、蝇、叶蝉或蓟马 (*thrip*), 其

可向植物传播植物病毒。能够传播植物病毒的其他病媒是蛛状螨、虱、甲虫和线虫。

[0264] 在本发明的上下文中,病媒的其他实例为昆虫和蛛形纲动物,例如蚊,尤其是伊蚊属、按蚊属的蚊类,例如冈比亚按蚊 (*A.gambiae*)、阿拉伯按蚊 (*A.arabiensis*)、不吉按蚊 (*A.funestus*)、大劣按蚊 (*A.dirus*) (疟疾);以及库蚊属蚊子、虱、跳蚤、蝇、螨和蝉,其可向动物和/或人类传播病原体。

[0265] 如果式 (I) 的化合物为抗性突破 (resistance-breaking) 的,则病媒防治也是可能的。

[0266] 式 (I) 的化合物适合用于预防由病媒传播的疾病和/或病原体。因此,本发明的另一方面为式 (I) 的化合物在例如农业、园艺、林业、园林以及休闲设备中、以及在材料和贮存产品的保护中用于病媒防治的用途。

[0267] 工业材料的保护

[0268] 式 (I) 的化合物适合用于保护工业材料免受昆虫的侵害或破坏,例如来自鞘翅目、膜翅目、等翅目、鳞翅目、啮虫目和衣鱼目 (*Zygentoma*) 的昆虫的侵害或破坏。

[0269] 在本上下文中,工业材料应理解为意指无生命材料,例如,优选塑料、粘合剂、胶料、纸和纸片、皮革、木材及加工的木制品和涂层组合物。特别优选本发明用于保护木材的用途。

[0270] 在另一实施方案中,式 (I) 的化合物与至少一种其他杀昆虫剂和/或至少一种杀真菌剂一起使用。

[0271] 在另一实施方案中,式 (I) 的化合物以即用型 (ready-to-use) 农药存在,即它们不需要其他修饰即可应用到所讨论的材料上。特别地,合适的其他杀昆虫剂或杀真菌剂为上述提及的杀昆虫剂或杀真菌剂。

[0272] 出人意料地,还发现,式 (I) 的化合物可用于保护与盐水或微咸水接触的物体免受污染,尤其是船体、筛、网、建筑物、系泊设备及信号系统。同样可能的是,式 (I) 的化合物可单独或与其他活性化合物结合用作防污剂。

[0273] 卫生领域中动物有害物的防治

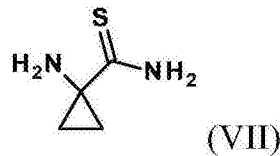
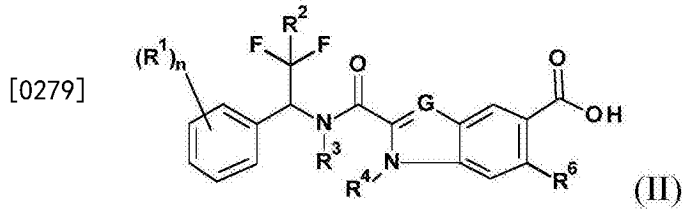
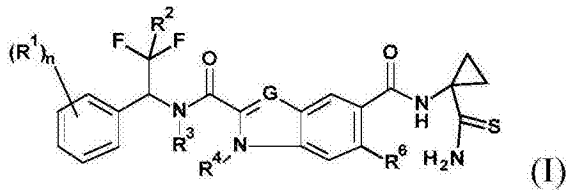
[0274] 式 (I) 的化合物适合用于防治卫生领域的动物有害物。更具体而言,本发明可以用于家用领域、卫生领域以及储存产品的保护中,特别是用于防治密闭空间中的昆虫、蛛形纲动物和螨虫,所述密闭空间为例如住所、工厂车间、办公室、车厢。为了防治动物有害物,式 (I) 的化合物可单独或与其他活性化合物和/或助剂结合使用。它们优选用于家用的杀昆虫剂产品中。式 (I) 的化合物对敏感的及抗性物种以及对全部发育阶段有效。

[0275] 这些有害物包括,例如,下述有害物:蛛形纲,蝎目 (*Scorpiones*)、蜘蛛目 (*Araneae*) 和盲蛛目 (*Opiliones*);唇足纲和倍足纲;昆虫纲蜚蠊目、鞘翅目、革翅目、双翅目、异翅亚目、膜翅目、等翅目、鳞翅目、虱目 (*Phthiraptera*)、啮虫目、跳跃目 (*Saltatoria*) 或直翅目、蚤目和衣鱼目;软甲亚纲等足目。

[0276] 施用以下列形式进行:气雾剂、无压喷雾产品如泵式喷雾剂和雾化喷雾剂、自动起雾体系、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、螺旋桨式蒸发器、无动力 (energy-free) 或无源 (passive) 的蒸发体系、捕蛾纸、捕蛾袋和捕蛾胶,作为颗粒剂或粉剂,以撒播饵料 (bait) 使用或用于饵料点 (bait station)。

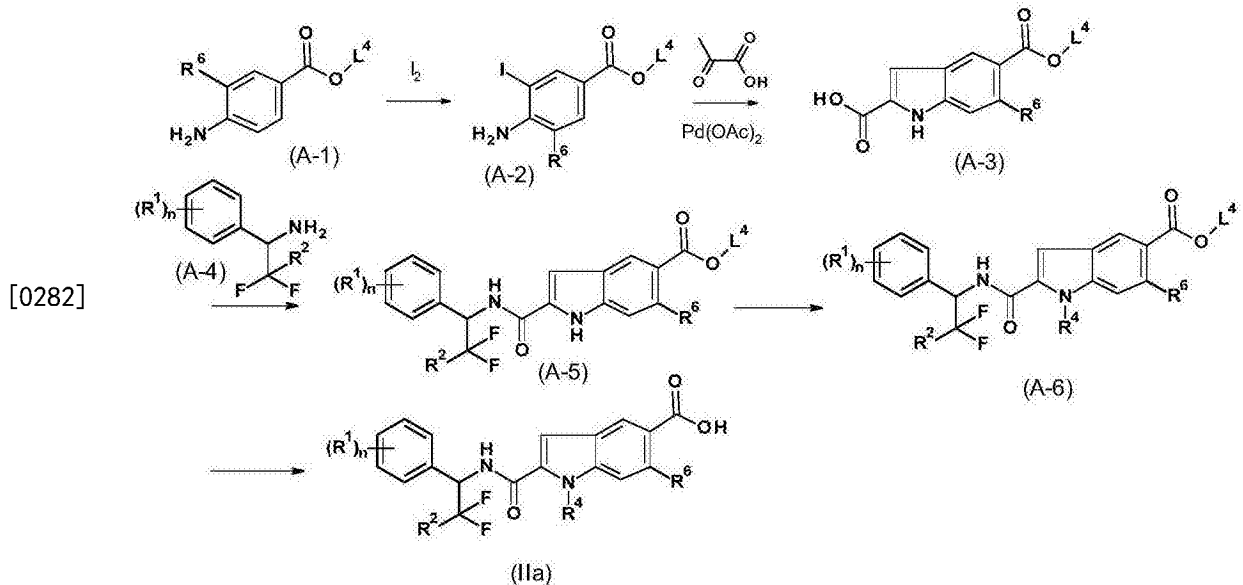
[0277] 方法和中间体的说明

[0278] 通式 (I) 的化合物可由通式 (II) 的羧酸与式 (VII) 的 1-氨基环丙烷硫代甲酰胺在缩合剂 (例如 [苯并三唑-1-基氧基 (二甲氨基) 亚甲基] 六氟磷酸二甲基铵) 的存在下反应而获得。



[0280] 式 (IIa) 的某些咪唑羧酸是已知的 (参见, 例如, WO-A-2012/119984)。类似于 WO-A-2012/119984 中记载的方法, 也可以根据方案 1 获得式 (IIa) 的新的化合物。此处, L<sup>4</sup> 代表氢。

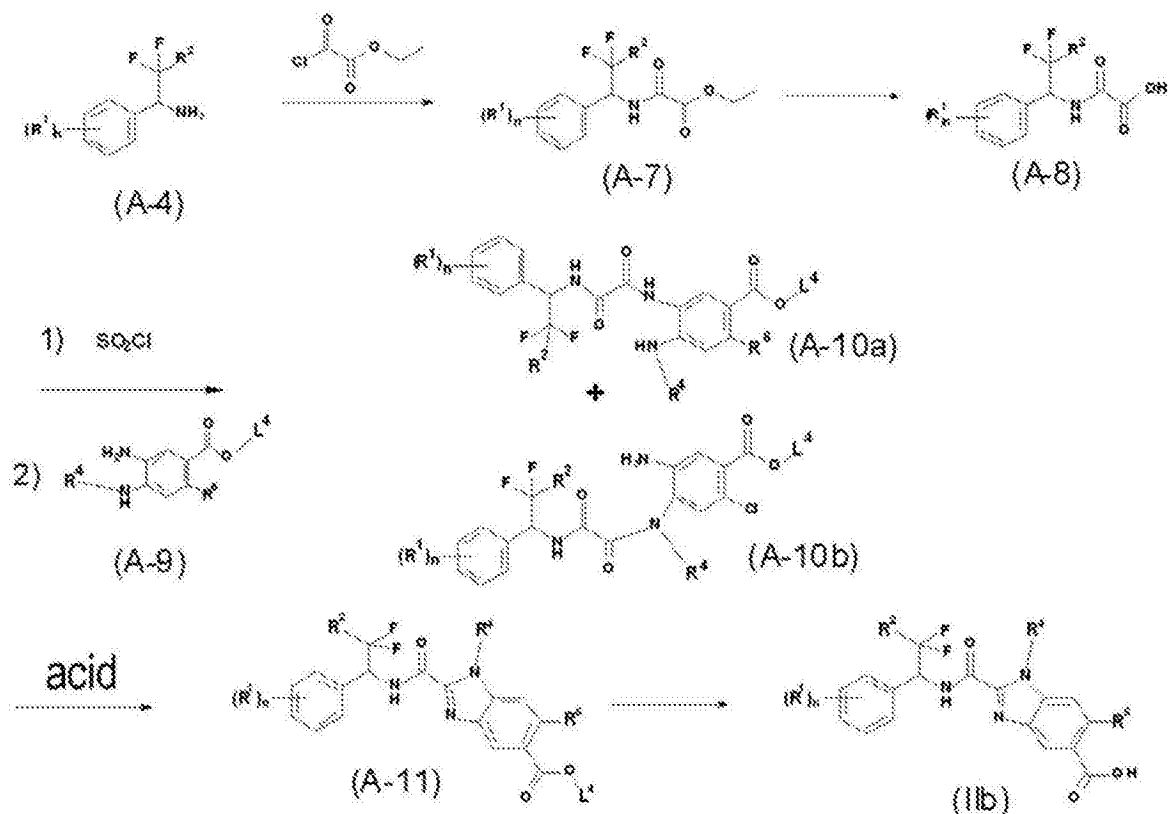
[0281] 方案 1



[0283] 式 (IIb) 的苯并咪唑羧酸是新颖的且可例如根据方案 2 获得。

[0284] 方案 2

[0285]



[0286] 式 (IIb) 的苯并咪唑衍生物通过用例如 NaOH 水解式 (A-11) 的化合物而获得。式 (A-11) 的化合物可由式 (A-10b) 的化合物通过在酸性催化剂 (例如, 4-甲苯磺酸水合物、盐酸或乙酸) 的存在下反应而获得。反应在用于类似化合物的文献 (参见, 例如, EP1602648, 实施例 4; Journal of Medicinal Chemistry, 55 (2012) 9089-9106) 中所公开的条件下进行。

[0287] 式 (A-10b) 的化合物以及式 (A-10a) 的化合物可通过首先将式 (A-8) 的化合物与亚硫酰氯反应, 然后将中间体 (不经分离) 与式 (A-9) 的 1,2-二氨基苯基衍生物反应而一起获得。反应在用于类似化合物的文献 (参见, 例如, EP1602648, 实施例 4; Journal of Medicinal Chemistry, 55 (2012) 9089-9106) 中所公开的条件下进行。

[0288] 式 (A-9) 的 1,2-二氨基苯基衍生物是已知的 (参见, 例如 W02012/119984)。式 (A-8) 的羧酸可通过式 (A-7) 的酯的水解来获得。

[0289] 式 (A-8) 的羧酸可以类似于由文献获知的方法, 通过由通式结构 (A-7) 的化合物的酯水解来制备 (例如, 使用 NaOH 或 LiOH。对于其他方法参见, 例如, Tetrahedron 49 (1993) 3691-3748)。

[0290] 式 (A-7) 的化合物通过式 (A-4) 的胺与 2-氯-2-氧代乙酸乙酯反应而获得。反应在用于类似化合物的文献 (参见, 例如, EP1997813, 210 页, 实施例 8, 步骤 1) 中所公开的条件下进行。

[0291] 通式 (A-4) 的卤代烷基取代的胺是市售可得的, 由文献中获知或可使用由文献 (参见, 例如, W02012/119984) 中获知的方法来合成。

[0292] 式 (VII) 的 1-氨基环丙烷硫代甲酰胺 (CAS 号 1159877-97-0; W02009/070485) 是市售可得的。

[0293] 本发明用于制备式 (I) 的新化合物的方法优选使用稀释剂来实施。用于实施本发

明的方法的有用的稀释剂为所有的惰性溶剂以及水。可提及的实例为：卤代烃（例如氯代烃，例如四氯乙烯、四氯乙烷、二氯丙烷、二氯甲烷、二氯丁烷、氯仿、四氯化碳、三氯乙烷、三氯乙烯、五氯乙烷、二氟苯、1,2-二氯乙烷、氯苯、溴苯、二氯苯、氯甲苯、三氯苯）、醇（例如甲醇、乙醇、异丙醇、丁醇）、醚（例如乙基丙基醚、甲基叔丁基醚、苯甲醚、苯乙醚、环己基甲基醚、二甲醚、二乙醚、二丙醚、二异丙醚、二正丁基醚、二异丁基醚、二异戊基醚、乙二醇二甲醚、四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯二乙醚以及环氧乙烷和/或环氧丙烷的聚醚）、胺（例如三甲胺、三乙胺、三丙胺、三丁胺、N-甲基吗啉、吡啶和四亚甲基二胺）、硝基烃（例如硝基甲烷、硝基乙烷、硝基丙烷、硝基苯、氯硝基苯、邻硝基甲苯）；腈（如乙腈、丙腈、丁腈、异丁腈、苄腈、间氯苄腈）、四氢噻吩二氧化物、二甲亚砷、四亚甲基亚砷、二丙基亚砷、苄基甲基亚砷、二异丁基亚砷、二丁基亚砷、二异戊基亚砷、砷（例如二甲基砷、二乙基砷、二丙基砷、二丁基砷、二苯基砷、二己基砷、甲基乙基砷、乙基丙基砷、乙基异丁基砷和五亚甲基砷）、脂族、脂环族或芳族烃（例如戊烷、己烷、庚烷、辛烷、壬烷和工业烃），以及具有沸点为例如40℃至250℃的组分的所谓的“石油溶剂油 (white spirit)”、百里香素 (cymene)、沸点在70℃至190℃范围内的石油馏分、环己烷、甲基环己烷、石油醚 (petroleum ether)、轻石油 (ligroin)、辛烷、苯、甲苯、氯苯、溴苯、硝基苯、二甲苯、酯（例如乙酸甲酯、乙酸乙酯、乙酸丁酯和乙酸异丁酯、碳酸二甲酯、碳酸二丁酯和碳酸亚乙酯）、酰胺（例如六甲基磷酰胺、甲酰胺、N-甲基甲酰胺、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二丙基甲酰胺、N,N-二丁基甲酰胺、N-甲基-吡咯烷、N-甲基己内酰胺、1,3-二甲基-3,4,5,6-四氢-2(1H)-咪啉、辛基吡咯烷酮、辛基己内酰胺、1,3-二甲基-2-咪唑啉二酮、N-甲酰基哌啶、N,N'-二甲酰基哌啶）和酮（例如丙酮、苯乙酮、甲基乙基酮、甲基丁基酮）。

[0294] 当然也可能以所提到的溶剂和稀释剂的混合物的形式来实施本发明的方法。

[0295] 当实施本发明的方法时，反应温度可以在相对宽的范围内变化。通常，所述方法在-30℃至+150℃，优选-10℃至+100℃的温度下进行。

[0296] 通常在大气压下实施本发明的方法。然而，也有可能是在升高或降低的压力下——通常在0.1bar至15bar的绝对压力下——实施本发明的方法。

[0297] 为了实施本发明的方法，通常以大约等摩尔的量使用起始原料。然而，也可能以相对较大的过量使用组分之一。所述反应通常在合适的稀释剂中在反应助剂的存在下进行，任选地还在保护气体气氛下（例如在氮气、氩气或氦气下）进行，并且通常将反应混合物在所需的温度下搅拌数小时。后处理通过常规方法（参见制备实施例）来进行。

[0298] 用于实施本发明的方法的基本反应助剂可以是所有合适的缚酸剂。实例包括：碱土金属或碱金属化合物（例如锂、钠、钾、镁、钙和钡的氢氧化物、氢化物、氧化物和碳酸盐）；咪碱或胍碱（例如7-甲基-1,5,7-三氮杂二环[4.4.0]癸-5-烯 (MTBD)；二氮杂二环[4.3.0]壬烯 (DBN)、二氮杂二环[2.2.2]辛烷 (DABCO)、1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳烯 (DBU)、环己基四丁基胍 (CyTBG)、环己基四甲基胍 (CyTMG)、N,N,N,N-四甲基-1,8-萘二胺、五甲基哌啶)；和胺，尤其是叔胺（例如三乙胺、三甲胺、三苄胺、三异丙胺、三丁胺、三环己胺、三戊胺、三己胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基甲苯胺、N,N-二甲基-对氨基吡啶、N-甲基吡咯烷、N-甲基哌啶、N-甲基咪唑、N-甲基吡啶、N-甲基吗啉、N-甲基六亚甲基二胺、吡啶、4-吡咯烷基吡啶、4-二甲基氨基吡啶、喹啉、 $\alpha$ -甲基吡啶、 $\beta$ -甲基吡啶、咪啉、吡啶、N,N,N',N'-四亚甲基二胺、N,N,N',N'-四亚乙基二胺、喹啉、N-丙基二异丙基胺、N-乙基二异丙基胺、N,N'-二

甲基环己胺、2,6-二甲基吡啶、2,4-二甲基吡啶或三亚乙基二胺)。

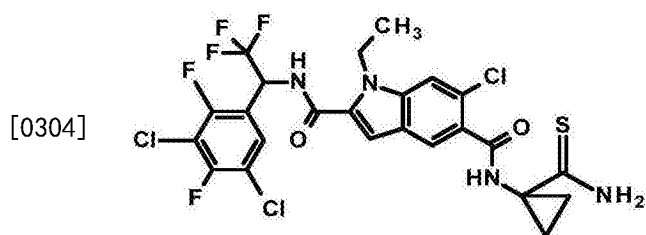
[0299] 用于实施本发明的方法的酸性反应助剂包括所有无机酸(例如氢卤酸,例如氢氟酸、盐酸、氢溴酸或氢碘酸,以及硫酸、磷酸、亚磷酸、硝酸)、路易斯酸(例如氯化铝(III)、三氟化硼或其醚合物、氯化钛(IV)、氯化锡(IV))和有有机酸(例如甲酸、乙酸、丙酸、丙二酸、乳酸、草酸、富马酸、己二酸、硬脂酸、酒石酸、油酸、甲磺酸、苯甲酸、苯磺酸或对甲苯磺酸)。

[0300] 以下制备实施例和用途实施例解释了本发明而非对其进行限制。

[0301] 制备实施例

[0302] 合成实施例1

[0303] N5-(1-硫代氨基甲酰基环丙基)-6-氯-N2-[1-(3,5-二氯-2,4-二氟苯基)-2,2,2-三氟乙基]-1-乙基吡啶-2,5-二甲酰胺(化合物编号I-01)



[0305] 将6-氯-1-乙基-2-({2,2,2-三氟-1-[3,5-二氯-2,4-二氟苯基]乙基}氨基甲酰基)-1H-吡啶-5-甲酸(由根据W0-A-2012/119984的方法制备,参见第64页第16行-第65页第1行和第66页第8-11行)(0.523g,0.98mmol)溶于DMF(9mL)中。相继加入1-氨基环丙烷硫代甲酰胺(0.150mg,0.98mmol)、[苯并三唑-1-基氧基(二甲氨基)亚甲基]六氟磷酸二甲铵(0.374g,0.98mmol)和N-甲基吗啉(0.200g,1.97mmol),然后将反应混合物在室温下搅拌15小时。加入乙酸乙酯,将反应混合物用盐酸(1.0M)和饱和氯化钠水溶液依次洗涤并用硫酸镁干燥,然后减压蒸馏除去溶剂。将残留物在硅胶上用流动相环己烷/乙酸乙酯(60:40)进行层析,得到0.430g(理论值的67%)的N5-(1-硫代氨基甲酰基环丙基)-6-氯-N2-[1-(3,5-二氯-2,4-二氟苯基)-2,2,2-三氟乙基]-1-乙基吡啶-2,5-二甲酰胺。HPLC-MS:logP=4.25;质量(m/z):627.0(M+H)<sup>+</sup>

[0306] 合成实施例2

[0307] 合成实施例1(化合物编号I-01)的对映异构体分离通过制备正相色谱法在手性固定相上使用以下条件进行:柱:CHIRALPAK AS-H 5 $\mu$ m-250 $\times$ 4.6mm;

[0308] 流动相:A=正庚烷,B=甲醇+乙醇(1:1),A:B=85:15;流速:0.8mL/min;25 $^{\circ}$ C。

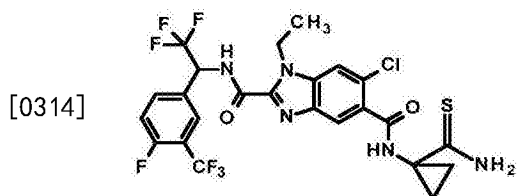
[0309] 430mg的N5-(1-硫代氨基甲酰基环丙基)-6-氯-N2-[1-(3,5-二氯-2,4-二氟苯基)-2,2,2-三氟乙基]-1-乙基吡啶-2,5-二甲酰胺(合成实施例1,化合物编号I-01),得到:

[0310] 171mg的化合物I-18,(+)-对映异构体(保留时间:7.5分钟,ee>99%,旋光度:+112.9 $^{\circ}$ )。

[0311] 172mg的化合物I-17,(-)-对映异构体(保留时间:9.8分钟,ee>99%,旋光度:-103.1 $^{\circ}$ )。

[0312] 合成实施例3

[0313] N5-(1-硫代氨基甲酰基环丙基)-6-氯-1-乙基-N2-{2,2,2-三氟-1-[4-氟-3-(三氟甲基)苯基]乙基}-1H-苯并咪唑-2,5-二甲酰胺(化合物编号I-30)



[0315] 步骤1: 氧代({2,2,2-三氟-1-[4-氟-3-(三氟甲基)苯基]乙基}氨基)乙酸乙酯

[0316] 将在三氯甲烷(200mL)中的2,2,2-三氟-1-[4-氟-3-(三氟甲基)苯基]乙胺(15.0g, 57.4mmol)和4-甲基吗啉(7.58mL, 68.9mmol)的混合物冷却至0℃, 缓慢滴加乙基草酰氯(8.23g, 60.3mmol)于氯仿(100mL)中的溶液, 然后将混合物升至室温搅拌15小时。将反应混合物倒入水中, 并用5%浓度的磷酸氢二钠溶液萃取两次, 将有机相用硫酸钠干燥并减压蒸出溶剂。得到20.4g(理论值的99%)的氧代({2,2,2-三氟-1-[4-氟-3-(三氟甲基)苯基]乙基}氨基)乙酸乙酯, 将其不经任何进一步纯化而进一步处理。HPLC-MS: logP=3.17; 质量(m/z): 362.0 (M+H)<sup>+</sup>

[0317] 步骤2: 氧代({2,2,2-三氟-1-[4-氟-3-(三氟甲基)苯基]乙基}氨基)乙酸

[0318] 首先将氧代({2,2,2-三氟-1-[4-氟-3-(三氟甲基)苯基]乙基}氨基)乙酸乙酯(20.42g, 56.0mmol)加入到甲醇(200mL)和水(26mL)的混合物中, 在搅拌下加入氢氧化钠(8.97g, 224mmol)。将反应混合物在室温下搅拌15小时, 然后将大部分溶剂减压蒸出。将残留物溶于水/叔丁基甲基醚, 将相分离并用叔丁基甲基醚萃取水相两次。然后将水相用10%浓度的盐酸酸化至pH 3, 并用乙酸乙酯反复萃取。将合并的有机相用饱和氯化钠溶液洗涤并用硫酸钠干燥, 减压蒸馏除去溶剂。得到19.55g(理论值的85%)氧代({2,2,2-三氟-1-[4-氟-3-(三氟甲基)苯基]乙基}氨基)乙酸, 将其不经任何进一步纯化而进一步处理。HPLC-MS: logP=1.84; 质量(m/z): 332.0 (M+H)<sup>+</sup>

[0319] 步骤3a: 5-氨基-2-氯-4-(乙基氨基)苯甲酸乙酯

[0320] 2-氯-4-(乙基氨基)-5-硝基苯甲酸乙酯: 首先将2-氯-4-氟-5-硝基苯甲酸乙酯(3.60g, 14.5mmol)加入到THF(28mL)中, 并加入2M的乙胺于THF中的溶液(14.5mL, 29mmol)。然后将混合物在室温下搅拌15小时。对于后处理, 将反应混合物加入到水中并用乙酸乙酯萃取两次。将合并的有机相用水和5%浓度的磷酸氢二钠溶液洗涤并用硫酸钠干燥, 减压蒸馏除去溶剂。将残留物在硅胶上用环己烷/乙酸乙酯进行层析, 得到2.80g(理论值的71.3%)的2-氯-4-(乙基氨基)-5-硝基苯甲酸乙酯。HPLC-MS: logP=3.49; 质量(m/z): 273.0 (M+H)<sup>+</sup>

[0321] 5-氨基-2-氯-4-(乙基氨基)苯甲酸乙酯: 首先将2-氯-4-(乙基氨基)-5-硝基苯甲酸乙酯(2.47g, 9.05mmol)加入在乙醇(86mL)/水(14mL)中, 并加入氯化铵(775.2mg, 14.4mmol)。将反应混合物温热至60℃, 加入铁粉(5.06g, 90.5mmol), 然后将混合物回流搅拌3小时。冷却后, 将混合物通过硅藻土过滤, 将滤饼用乙醇反复洗涤并减压蒸馏除去溶剂。将残留物溶于乙酸乙酯, 将溶液用水和饱和氯化钠溶液洗涤, 用硫酸钠干燥并蒸馏除去溶剂。得到2.16g(理论值的83%)5-氨基-2-氯-4-(乙基氨基)苯甲酸乙酯。HPLC-MS: logP=2.31; 质量(m/z): 243.0 (M+H)<sup>+</sup>

[0322] 步骤3: 2-氯-4-(乙基氨基)-5-[[氧代({2,2,2-三氟-1-[4-氟-3-(三氟甲基)苯基]乙基}氨基)乙酰基]氨基]苯甲酸乙酯

[0323] 将氧代({2,2,2-三氟-1-[4-氟-3-(三氟甲基)苯基]乙基}氨基)乙酸(2.30g,



6.90mmol) 溶于三氯甲烷 (50mL) 中, 加入亚硫酸氯 (2.05g, 17.2mmol) 和 2 滴 DMF, 并将混合物在 50°C 下搅拌 15 小时。减压蒸馏除去溶剂, 将残留物溶于少许三氯甲烷中并滴加到来自步骤 3a 的 5-氨基-2-氯-4-(乙基氨基) 苯甲酸乙酯 (2.16g, 7.59mmol) 和三乙胺 (2.4mL, 17.2mmol) 于三氯甲烷 (25mL) 的溶液中。室温下搅拌 48 小时后, 减压蒸馏除去大部分溶剂, 并将残留物溶于水/乙酸乙酯中。分离各相并用乙酸乙酯萃取水相两次。将合并的有机相用 5% 浓度的磷酸氢二钠溶液洗涤并用硫酸钠干燥, 减压蒸馏除去溶剂。得到 4.5g (理论值的 54%) 的 2-氯-4-(乙基氨基)-5-[[氧代({2,2,2-三氟-1-[4-氟-3-(三氟甲基) 苯基] 乙基} 氨基) 乙酰基] 氨基] 苯甲酸乙酯, 将其不经纯化而进一步反应。HPLC-MS: logP=4.36; 质量 (m/z): 558.0 (M+H)<sup>+</sup>

[0324] 步骤 4: 6-氯-1-乙基-2-({2,2,2-三氟-1-[4-氟-3-(三氟甲基) 苯基] 乙基} 氨基甲酰基)-1H-苯并咪唑-5-甲酸乙酯

[0325] 将 2-氯-4-(乙基氨基)-5-[[氧代({2,2,2-三氟-1-[4-氟-3-(三氟甲基) 苯基] 乙基} 氨基) 乙酰基] 氨基] 苯甲酸乙酯 (4.50g, 8.06mmol) 溶于甲苯 (90mL) 中, 加入对甲苯磺酸一水合物 (0.30g, 1.61mmol) 并将该混合物在水分离器上回流搅拌 15 小时。冷却后, 将混合物用饱和碳酸氢钠溶液洗涤并用硫酸钠干燥, 减压蒸馏除去溶剂。将残留物在硅胶上用流动相环己烷/乙酸乙酯 (80:20) 进行层析。得到 0.99g (理论值的 20%) 6-氯-1-乙基-2-({2,2,2-三氟-1-[4-氟-3-(三氟甲基) 苯基] 乙基} 氨基甲酰基)-1H-苯并咪唑-5-甲酸乙酯。HPLC-MS: logP=5.03; 质量 (m/z): 541.0 (M+H)<sup>+</sup> <sup>1</sup>H NMR (D<sub>3</sub>-DMSO): δ 1.33 (t, 3H), 1.37 (t, 3H), 4.37 (q, 2H), 4.60 (q, 2H), 6.36 (m, 1H), 7.64 (m, 1H), 7.69 (s, 1H), 8.21 (m, 2H), 8.42 (m, 1H), 8.62 (s, 1H)。

[0326] 步骤 5: 6-氯-1-乙基-2-({2,2,2-三氟-1-[4-氟-3-(三氟甲基) 苯基] 乙基} 氨基甲酰基)-1H-苯并咪唑-5-甲酸

[0327] 首先将 6-氯-1-乙基-2-({2,2,2-三氟-1-[4-氟-3-(三氟甲基) 苯基] 乙基} 氨基甲酰基)-1H-苯并咪唑-5-甲酸乙酯 (0.495g, 0.81mmol) 加入到二噁烷 (25mL) / 水 (2.8mL) 中, 并加入氢氧化锂 (58.3mg, 2.43mmol)。将反应混合物在室温下搅拌 48 小时, 之后减压蒸馏除去溶剂。将残留物溶于水中, 并用浓盐酸调节至 pH 1。滤出析出的固体并干燥。得到 366mg (理论值的 83%) 的 6-氯-1-乙基-2-({2,2,2-三氟-1-[3-(三氟甲基) 苯基] 乙基} 氨基甲酰基)-1H-吡啶-5-甲酸。

[0328] HPLC-MS: logP=3.66; 质量 (m/z): 512.1 (M+H)<sup>+</sup> <sup>1</sup>H NMR (D<sub>3</sub>-DMSO): δ 1.31 (t, 3H), 4.60 (q, 2H), 6.30 (m, 1H), 7.64 (m, 1H), 8.06 (s, 1H), 8.2-8.3 (m, 3H), 8.43 (m, 1H)。

[0329] 步骤 6: N<sub>5</sub>-(1-硫代氨基甲酰基环丙基)-6-氯-1-乙基-N<sub>2</sub>-{2,2,2-三氟-1-[4-氟-3-(三氟甲基) 苯基] 乙基}-1H-苯并咪唑-2,5-二甲酰胺 (化合物编号 I-30)

[0330] 将 6-氯-1-乙基-2-({2,2,2-三氟-1-[3-(三氟甲基) 苯基] 乙基} 氨基甲酰基)-1H-吡啶-5-甲酸 (200mg, 0.37mmol) 溶于 DMF (2mL) 中。相继加入 1-氨基环丙烷硫代甲酰胺 (62.2mg, 0.40mmol)、[苯并三唑-1-基氧基(二甲氨基) 亚甲基] 六氟磷酸二甲基铵 (154mg, 0.40mmol) 和 N-甲基吗啉 (112mg, 1.11mmol), 然后将该混合物在室温下搅拌 15 小时。将反应混合物倒入水中并用乙酸乙酯萃取。用饱和氯化钠溶液洗涤后, 将混合物用硫酸镁干燥, 然后减压蒸馏除去溶剂。将残留物在硅胶上用流动相环己烷/乙酸乙酯 (60:40) 进行层析, 得到 0.139g (理论值的 54%) N<sub>5</sub>-(1-硫代氨基甲酰基环丙基)-6-氯-1-乙基-N<sub>2</sub>-{2,2,2-三氟-



[0334]

编号	(R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	G	R <sup>6</sup>	(M+H) <sup>+</sup> <sup>a)</sup>	log p <sup>a)</sup>
I-01	2,4-F <sub>2</sub> ; 3,5-Cl <sub>2</sub>	F	H	Et	CH	Cl	627.0	4.25
I-02	3,5-Cl <sub>2</sub> ; 4-F	F	H	Et	CH	Cl	610.0	4.04
I-03	3-CF <sub>3</sub> ; 4-F	F	H	Et	CH	Cl	609.1	3.70
I-04	3-Cl; 4-F	F	H	Et	CH	Cl	575.1	3.57
I-05	3,4,5-Cl <sub>3</sub>	F	H	Et	CH	Cl	625.0	4.33
I-06	3-Br; 4-F	F	H	Et	CH	Cl	619.0	3.64
I-07	3-CF <sub>3</sub> ; 4-Cl	F	H	Et	CH	Cl	625.1	3.96
I-08	2,4-F <sub>2</sub> ; 3,5-Cl <sub>2</sub>	F	H	Me	CH	Cl	613.0	3.94
I-09	3,4-Cl <sub>2</sub> ; 5-F	F	H	Et	CH	Cl	610.0	4.02
I-10	3-F; 5-CF <sub>3</sub>	F	H	Et	CH	Cl	609.0	3.81
I-11	2-F; 3-Cl	F	H	Et	CH	Cl	575.1	3.69
I-12	2,4-F <sub>2</sub> ; 3,5-Cl <sub>2</sub>	F	H	丙-2-炔-1-基	CH	Cl	637.1	3.94
I-13	3-CF <sub>3</sub> ; 4-Cl	F	H	Et	CH	Me	605.0	3.89
I-14	3,5-Cl <sub>2</sub> ; 4-F	F	H	丙-2-炔-1-基	CH	Cl	618.9	3.81
I-15	3,5-Cl <sub>2</sub> ; 4-F	F	H	Me	CH	Cl	595.0	3.76
I-16	3-CF <sub>3</sub> ; 4-Cl	F	H	Me	CH	Cl	611.1	3.70

编号	(R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	G	R <sup>6</sup>	(M+H) <sup>+</sup> <sup>a)</sup>	log p <sup>a)</sup>
I-17	2,4-F <sub>2</sub> ; 3,5-Cl <sub>2</sub>	F	H	Et	CH	Cl	627.0	4.27; (-)-对映异构体
I-18	2,4-F <sub>2</sub> ; 3,5-Cl <sub>2</sub>	F	H	Et	CH	Cl	627.0	4.27; (+)-对映异构体
I-19	3-CF <sub>3</sub> ; 4-Cl	F	H	丙-2-炔-1-基	CH	Cl	635.1	3.73
I-20	3,4,5-Cl <sub>3</sub>	F	H	Me	CH	Cl	612.0	4.07
I-21	3,4,5-Cl <sub>3</sub>	F	H	丙-2-炔-1-基	CH	Cl	636.0	4.09
I-22	3-Cl; 5-CF <sub>3</sub>	F	H	Et	CH	Cl	625.0	4.11
I-23	3,5-F <sub>2</sub>	H	H	Et	CH	Cl	541.0	3.07
I-24	3,5-Cl <sub>2</sub>	H	H	Et	CH	Cl	573.9	3.65
I-25	3,4-Cl <sub>2</sub>	H	H	Et	CH	Cl	573.9	3.54
I-26	2,3,4-F <sub>3</sub> ; 5-Cl	F	H	Et	CH	Cl	612.1	3.99
I-27	2,5-F <sub>2</sub> ; 3,4-Cl <sub>2</sub>	F	H	Et	CH	Cl	628.1	4.28
I-28	2,4-F <sub>2</sub> ; 3,5-Cl <sub>2</sub>	H	H	Et	CH	Cl	610.1	3.90
I-29	2,3-F <sub>2</sub> ; 4,5-Cl <sub>2</sub>	F	H	Et	CH	Cl	628.1	4.27
I-30	3-CF <sub>3</sub> ; 4-F	F	H	Et	N	Cl	609.9	3.46
I-31	2,3,5-F <sub>3</sub> ; 4-Cl	F	H	Et	CH	Cl	612.3	4.02
I-32	3-CF <sub>3</sub> ; 4-F	H	H	Et	CH	Cl	591.1	3.41

[0335]

[0336] 缩写:Et=乙基,Me=甲基;

[0337] <sup>1</sup>H NMR数据<sup>b)</sup>

[0338]

实施例 I-01: <sup>1</sup>H NMR (400.0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):

δ= 9.775 (7.0); 9.751 (4.4); 8.874 (9.1); 8.768 (3.4); 8.281 (2.3); 8.262 (4.2); 8.244 (2.2); 8.125 (15.4); 7.817 (11.1); 7.406 (11.0); 6.397 (0.4); 6.376 (1.6); 6.355 (2.3); 6.333 (1.7); 6.312 (0.5); 4.544 (1.7);

[0339]

4.527 (4.9); 4.509 (4.8); 4.491 (1.6); 3.323 (111.7); 2.680 (0.6); 2.676 (1.2); 2.671 (1.6); 2.667 (1.2); 2.662 (0.5); 2.525 (5.4); 2.511 (92.8); 2.507 (182.2); 2.502 (236.5); 2.498 (169.4); 2.493 (80.0); 2.338 (0.6); 2.333 (1.2); 2.329 (1.6); 2.324 (1.1); 2.320 (0.5); 1.858 (3.2); 1.848 (7.1); 1.838 (7.7); 1.829 (3.1); 1.398 (4.8); 1.336 (0.8); 1.273 (3.5); 1.263 (7.6); 1.253 (7.8); 1.243 (3.7); 1.233 (7.8); 1.216 (16.0); 1.198 (7.2); 0.146 (0.5); 0.008 (4.7); 0.000 (125.9); -0.009 (4.0); -0.150 (0.5)
<b>实施例 I-02: <sup>1</sup>H NMR (400.0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</b> $\delta$ = 9.771 (2.7); 9.635 (3.4); 9.611 (3.5); 8.871 (7.9); 8.771 (2.7); 8.120 (16.0); 8.115 (10.4); 8.099 (9.8); 7.853 (0.4); 7.806 (9.5); 7.399 (0.4); 7.381 (9.1); 6.323 (0.4); 6.302 (1.3); 6.280 (1.9); 6.258 (1.4); 6.236 (0.4); 4.543 (1.5); 4.526 (4.2); 4.508 (4.2); 4.491 (1.4); 3.790 (0.4); 3.752 (0.3); 3.324 (55.1); 2.680 (0.5); 2.676 (1.1); 2.671 (1.6); 2.667 (1.1); 2.662 (0.5); 2.541 (0.7); 2.525 (5.3); 2.520 (8.1); 2.511 (88.9); 2.507 (178.4); 2.502 (234.2); 2.498 (165.5); 2.493 (76.8); 2.338 (0.5); 2.333 (1.1); 2.329 (1.6); 2.324 (1.1); 2.320 (0.5); 2.075 (0.4); 1.858 (2.7); 1.847 (5.8); 1.838 (6.2); 1.829 (2.5); 1.273 (2.9); 1.263 (6.2); 1.253 (6.3); 1.243 (2.9); 1.231 (6.6); 1.214 (13.9); 1.196 (6.2); 0.146 (0.5); 0.008 (4.2); 0.000 (127.6); -0.009 (3.9); -0.150 (0.5)
<b>实施例 I-03: <sup>1</sup>H NMR (400.0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</b> $\delta$ = 9.765 (7.0); 9.741 (4.3); 8.868 (9.0); 8.772 (3.2); 8.316 (1.0); 8.296 (2.7); 8.283 (2.6); 8.182 (1.4); 8.177 (1.4); 8.171 (1.6); 8.162 (1.8); 8.155 (1.6); 8.149 (1.6); 8.117 (16.0); 7.802 (11.1); 7.688 (2.5); 7.662 (3.1); 7.639 (2.3); 7.370 (10.9); 6.388 (0.4); 6.366 (1.5); 6.344 (2.2); 6.322 (1.6); 6.300 (0.5); 4.542 (1.6); 4.525 (4.6); 4.507 (4.5); 4.489 (1.6); 3.326 (203.7); 3.303 (0.5); 2.681 (0.5); 2.676 (1.0); 2.672 (1.4); 2.667 (1.0); 2.663 (0.5); 2.525 (4.1); 2.520 (6.5); 2.512 (76.5); 2.507 (151.9); 2.503 (198.0); 2.498 (140.5); 2.493 (65.2); 2.338 (0.4); 2.334 (1.0); 2.329 (1.3); 2.325 (0.9); 2.320 (0.4); 2.075 (6.0); 1.858 (3.1); 1.848 (6.9); 1.839 (7.5); 1.829 (3.0); 1.272 (3.2); 1.262 (7.5); 1.253 (7.2); 1.243 (2.9); 1.224 (7.3); 1.207 (15.9); 1.189 (7.0); 0.146 (0.4); 0.008 (3.2); 0.000 (92.3); -0.009 (2.7); -0.150 (0.4)
<b>实施例 I-04: <sup>1</sup>H NMR (400.0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</b> $\delta$ = 9.768 (2.4); 9.666 (3.0); 9.642 (3.1); 8.868 (6.8); 8.776 (2.4); 8.111 (12.3); 8.088 (2.3); 8.083 (2.5); 8.070 (2.4); 8.065 (2.3); 7.801 (9.4); 7.790 (1.7); 7.784 (1.5); 7.778 (1.4); 7.772 (1.3); 7.568 (3.3); 7.545 (4.8); 7.523 (2.8); 7.375 (8.1); 6.234 (1.2); 6.212 (1.7); 6.189 (1.2); 6.167 (0.4); 4.545 (1.3); 4.528 (3.6); 4.510 (3.6); 4.492 (1.2); 3.329 (11.0); 2.676 (0.6); 2.671 (0.9); 2.667 (0.6); 2.525 (3.3); 2.520 (5.3); 2.511 (51.0); 2.507 (101.2); 2.502 (132.5); 2.498 (94.4); 2.493 (44.4); 2.334 (0.6); 2.329 (0.9); 2.324 (0.6); 2.076 (16.0); 1.858 (2.4); 1.847 (5.2); 1.838 (5.7); 1.829 (2.3); 1.273 (2.5); 1.263 (5.6); 1.254 (5.6); 1.243 (2.4); 1.227 (5.7); 1.209 (12.2); 1.191 (5.4); 0.008 (2.6); 0.000 (70.2); -0.009 (2.2)
<b>实施例 I-05: <sup>1</sup>H NMR (400.0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</b> $\delta$ = 9.769 (2.3); 9.661 (2.5); 9.637 (2.6); 8.872 (5.6); 8.772 (2.2); 8.150 (16.0); 8.121 (9.0); 7.806 (7.1); 7.383 (6.9); 6.319 (1.0); 6.297 (1.5); 6.274 (1.1); 6.253 (0.3); 4.542 (1.2); 4.525 (3.4); 4.507 (3.4); 4.490 (1.1); 3.325 (179.5); 2.676 (1.0); 2.672 (1.5); 2.667 (1.1); 2.525 (7.4); 2.511 (88.9); 2.507 (176.0); 2.502 (231.2); 2.498 (170.2); 2.494 (85.7); 2.334 (1.2); 2.329 (1.6); 2.325 (1.2); 2.075 (0.8); 1.858 (2.1); 1.847 (4.6); 1.838 (5.0); 1.829 (2.1); 1.355 (1.7); 1.273 (2.6); 1.263 (5.2); 1.254 (5.4); 1.243 (3.1); 1.231 (6.2); 1.214 (10.9); 1.196 (5.5); 0.853 (0.3); 0.785 (0.5); 0.768 (0.6); 0.146 (0.3); 0.008 (3.0); 0.000 (75.9); -0.008 (3.3); -0.149 (0.4)
<b>实施例 I-06: <sup>1</sup>H NMR (400.0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</b> $\delta$ = 9.765 (4.1); 9.662 (4.3); 9.638 (4.4); 8.867 (9.4); 8.773 (4.1); 8.316 (1.3); 8.197 (3.6); 8.192 (3.7); 8.181 (3.7); 8.176 (3.5); 8.111 (14.1); 7.839 (2.0); 7.834 (2.1); 7.828 (2.3); 7.819 (2.7); 7.799 (12.9); 7.524 (3.8); 7.502 (7.0); 7.481 (3.3); 7.373 (11.2); 6.249 (0.5); 6.228 (1.8); 6.206 (2.7); 6.183 (1.9); 6.161 (0.6); 5.757 (2.4); 4.543 (2.1); 4.525 (5.6); 4.508 (5.5); 4.490 (2.0); 4.020 (0.4); 3.405 (0.4); 3.323 (425.4); 2.890 (0.5); 2.731 (0.5); 2.671 (4.3); 2.666 (3.3); 2.624 (0.5); 2.506 (470.3); 2.502 (586.2); 2.497 (445.2); 2.373 (0.3); 2.333 (3.2); 2.328 (4.0); 2.324 (3.1); 2.086 (5.9); 1.989 (1.3); 1.856 (3.5); 1.846 (7.8); 1.837 (8.2); 1.828 (3.5); 1.271 (3.8); 1.261 (8.3); 1.252 (8.3); 1.242 (3.8); 1.225 (8.0); 1.208 (16.0); 1.190 (7.6); 1.175 (1.1); 1.157 (0.6); 1.148 (0.7); 0.146 (0.9); 0.000 (178.6); -0.150 (0.9)
<b>实施例 I-07: <sup>1</sup>H NMR (400.0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</b> $\delta$ = 9.797 (4.3); 9.772 (6.8); 8.867 (9.3); 8.773 (3.4); 8.336 (5.8); 8.333 (5.8); 8.317 (0.4); 8.118 (16.0); 8.104 (2.9); 8.082 (3.3); 8.079 (3.2); 7.892 (6.0); 7.871 (5.0); 7.802 (11.1); 7.371 (11.0); 6.405 (0.4); 6.384 (1.6); 6.362 (2.4); 6.340 (1.7); 6.318 (0.5); 4.539 (1.7); 4.522 (4.9); 4.504 (4.8); 4.486 (1.6); 3.324 (238.7); 2.680 (0.7); 2.676 (1.5); 2.671 (2.1); 2.667 (1.5); 2.662 (0.7); 2.524 (7.3); 2.511 (118.7); 2.507

[0340]

(232.8); 2.502 (302.9); 2.498 (218.1); 2.493 (104.6); 2.338 (0.7); 2.333 (1.5); 2.329 (2.0); 2.324 (1.5); 1.989 (0.7); 1.857 (3.2); 1.847 (6.9); 1.838 (7.5); 1.828 (3.1); 1.397 (14.5); 1.271 (3.3); 1.261 (7.4); 1.252 (7.4); 1.242 (3.1); 1.222 (7.4); 1.204 (15.7); 1.187 (7.1); 1.175 (0.8); 0.008 (1.5); 0.000 (40.3); -0.009 (1.4)
<p>实施例 I-08: <math>^1\text{H}</math> NMR (601.6 MHz, <math>d_6</math>-DMSO):</p> $\delta$ = 9.770 (1.5); 9.757 (1.1); 9.741 (1.0); 8.893 (3.8); 8.776 (1.4); 8.277 (0.9); 8.265 (1.5); 8.252 (0.8); 8.119 (5.9); 7.782 (4.3); 7.421 (4.1); 6.360 (0.5); 6.347 (0.8); 6.332 (0.6); 3.951 (16.0); 3.904 (3.1); 3.355 (1.1); 3.332 (1376.9); 3.296 (0.6); 3.285 (0.4); 3.172 (0.5); 3.163 (0.5); 3.029 (0.4); 2.617 (2.2); 2.614 (3.0); 2.611 (2.2); 2.541 (0.8); 2.523 (4.8); 2.520 (6.1); 2.517 (6.2); 2.508 (154.6); 2.505 (334.6); 2.502 (461.9); 2.499 (336.2); 2.496 (158.9); 2.389 (2.1); 2.386 (2.9); 2.383 (2.2); 1.902 (0.6); 1.851 (1.2); 1.845 (2.6); 1.839 (3.1); 1.834 (1.3); 1.434 (0.6); 1.298 (0.6); 1.268 (1.4); 1.262 (3.1); 1.255 (3.4); 1.249 (1.6); 1.244 (1.2); 1.235 (0.6); 0.005 (0.6); 0.000 (18.1); -0.006 (0.6)
<p>实施例 I-09: <math>^1\text{H}</math> NMR (400.0 MHz, <math>d_6</math>-DMSO):</p> $\delta$ = 9.770 (3.7); 9.661 (4.2); 9.636 (4.3); 8.871 (9.1); 8.774 (3.7); 8.119 (14.6); 8.038 (7.4); 7.958 (3.7); 7.934 (3.7); 7.852 (0.5); 7.807 (11.2); 7.715 (0.5); 7.404 (0.5); 7.386 (11.2); 6.339 (0.4); 6.318 (1.6); 6.296 (2.4); 6.274 (1.7); 6.252 (0.5); 4.545 (1.9); 4.528 (5.2); 4.510 (5.2); 4.493 (1.8); 4.056 (0.9); 4.038 (2.6); 4.020 (2.7); 4.003 (0.9); 3.324 (108.4); 3.031 (1.0); 2.772 (0.9); 2.676 (1.3); 2.671 (1.7); 2.667 (1.2); 2.507 (194.3); 2.502 (247.6); 2.498 (181.1); 2.333 (1.2); 2.329 (1.6); 2.325 (1.2); 1.989 (11.3); 1.858 (3.2); 1.848 (7.2); 1.839 (7.7); 1.830 (3.2); 1.397 (8.7); 1.352 (0.5); 1.335 (0.5); 1.314 (0.4); 1.298 (0.5); 1.273 (3.6); 1.263 (8.0); 1.254 (8.2); 1.243 (4.6); 1.232 (9.7); 1.214 (16.0); 1.197 (7.7); 1.175 (6.2); 1.157 (3.2); 0.853 (0.4); 0.146 (0.7); 0.008 (6.6); 0.000 (149.7); -0.008 (6.4); -0.150 (0.7)
<p>实施例 I-10: <math>^1\text{H}</math> NMR (400.0 MHz, <math>d_6</math>-DMSO):</p> $\delta$ = 9.768 (3.2); 9.753 (4.0); 9.729 (3.7); 8.870 (7.9); 8.772 (3.1); 8.316 (0.5); 8.125 (16.0); 8.067 (2.4); 8.044 (2.4); 7.832 (2.6); 7.805 (11.0); 7.388 (9.4); 6.439 (0.4); 6.418 (1.4); 6.397 (2.0); 6.375 (1.5); 6.352 (0.4); 4.544 (1.5); 4.527 (4.2); 4.509 (4.1); 4.492 (1.4); 3.324 (114.8); 2.676 (0.9); 2.672 (1.2); 2.667 (0.9); 2.542 (0.9); 2.511 (72.0); 2.507 (140.1); 2.503 (181.6); 2.498 (131.7); 2.494 (64.1); 2.334 (0.8); 2.329 (1.2); 2.325 (0.8); 2.075 (8.5); 1.858 (2.8); 1.848 (6.1); 1.839 (6.6); 1.830 (2.7); 1.272 (2.9); 1.262 (6.6); 1.253 (6.5); 1.243 (2.8); 1.227 (6.4); 1.209 (13.3); 1.192 (6.1); 0.008 (3.2); 0.000 (73.7); -0.008 (2.8)
<p>实施例 I-11: <math>^1\text{H}</math> NMR (400.0 MHz, <math>d_6</math>-DMSO):</p> $\delta$ = 9.851 (4.3); 9.827 (4.5); 9.765 (4.0); 8.869 (9.6); 8.777 (4.0); 8.106 (15.0); 7.914 (2.0); 7.896 (3.8); 7.878 (2.2); 7.806 (11.6); 7.753 (2.1); 7.750 (2.2); 7.732 (4.4); 7.714 (2.5); 7.711 (2.3); 7.431 (3.1); 7.411 (5.8); 7.399 (11.8); 6.400 (0.5); 6.380 (1.9); 6.358 (2.9); 6.336 (2.0); 6.314 (0.6); 4.544 (1.9); 4.527 (5.3); 4.509 (5.3); 4.491 (1.9); 3.326 (42.0); 2.892 (0.6); 2.732 (0.6); 2.690 (0.6); 2.672 (0.7); 2.507 (82.4); 2.503 (104.7); 2.499 (78.3); 2.330 (0.6); 1.858 (3.3); 1.847 (7.6); 1.838 (8.1); 1.829 (3.3); 1.397 (8.1); 1.273 (3.7); 1.263 (8.1); 1.254 (8.1); 1.244 (3.7); 1.223 (7.8); 1.205 (16.0); 1.188 (7.4); 0.000 (16.5)
<p>实施例 I-12: <math>^1\text{H}</math> NMR (400.0 MHz, <math>d_6</math>-DMSO):</p> $\delta$ = 9.841 (4.0); 9.817 (4.2); 9.774 (3.4); 8.901 (9.2); 8.783 (3.4); 8.315 (0.7); 8.267 (2.4); 8.249 (4.3); 8.230 (2.3); 8.157 (16.0); 7.904 (0.4); 7.848 (11.6); 7.495 (11.1); 6.388 (0.4); 6.368 (1.6); 6.347 (2.4); 6.325 (1.8); 6.303 (0.5); 5.479 (0.3); 5.437 (8.8); 3.321 (44.0); 3.226 (4.1); 3.220 (8.8); 3.214 (3.7); 2.676 (1.1); 2.671 (1.5); 2.667 (1.1); 2.662 (0.5); 2.541 (0.9); 2.524 (3.8); 2.511 (84.2); 2.506 (171.4); 2.502 (225.3); 2.497 (160.4); 2.493 (75.5); 2.338 (0.5); 2.333 (1.1); 2.329 (1.4); 2.324 (1.1); 2.320 (0.5); 2.074 (1.6); 1.861 (3.1); 1.852 (7.0); 1.842 (7.6); 1.833 (3.1); 1.754 (1.4); 1.276 (3.5); 1.267 (7.4); 1.257 (7.4); 1.247 (2.9); 0.146 (0.3); 0.008 (2.6); 0.000 (80.7); -0.009 (2.7); -0.150 (0.3)
<p>实施例 I-13: <math>^1\text{H}</math> NMR (400.0 MHz, <math>d_6</math>-DMSO):</p> $\delta$ = 9.685 (2.5); 9.661 (4.2); 8.872 (2.1); 8.659 (4.8); 8.340 (4.1); 8.104 (2.0); 8.083 (2.3); 7.961 (6.7); 7.887 (3.6); 7.866 (2.9); 7.500 (0.7); 7.466 (0.6); 7.431 (0.3); 7.410 (4.7); 7.331 (6.2); 7.319 (0.9); 6.872 (1.5); 6.642 (0.8); 6.375 (1.0); 6.353 (1.5); 6.330 (1.1); 5.757 (1.6); 4.520 (1.2); 4.503 (3.1); 4.486 (3.1); 4.468 (1.1); 3.602 (0.4); 3.325 (40.5); 3.027 (1.6); 2.759 (1.7); 2.676 (0.4); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.507 (66.9); 2.503 (77.9); 2.499 (52.7); 2.455 (15.7); 2.330 (0.7); 2.320 (1.9); 2.185 (2.3); 1.854 (2.0); 1.844 (4.3); 1.835 (4.3); 1.826 (1.7); 1.760 (0.5); 1.357 (16.0); 1.249 (2.7); 1.239 (6.8); 1.233 (8.1); 1.217 (9.4); 1.199 (4.2); 0.000 (10.5); -0.009 (0.3)

<p>实施例 I-14: <math>^1\text{H}</math> NMR (400.0 MHz, <math>\text{d}_6\text{-DMSO}</math>):</p> <p><math>\delta</math>= 9.770 (1.0); 9.685 (1.1); 9.662 (1.1); 8.897 (2.6); 8.783 (1.0); 8.315 (1.0); 8.152 (4.4); 8.109 (3.7); 8.093 (3.6); 7.892 (0.4); 7.853 (0.4); 7.841 (3.3); 7.499 (0.4); 7.480 (3.2); 6.305 (0.6); 6.282 (0.8); 6.263 (0.5); 5.445 (2.9); 5.441 (2.8); 3.790 (0.4); 3.332 (61.7); 3.217 (1.5); 3.211 (2.7); 3.205 (1.1); 2.675 (1.3); 2.671 (1.8); 2.666 (1.3); 2.541 (0.8); 2.524 (4.3); 2.510 (107.0); 2.506 (216.0); 2.502 (283.0); 2.497 (202.9); 2.493 (97.3); 2.333 (1.4); 2.328 (1.9); 2.324 (1.3); 2.196 (0.5); 2.179 (1.1); 2.160 (0.6); 1.861 (0.9); 1.851 (2.0); 1.842 (2.3); 1.832 (1.0); 1.593 (0.4); 1.579 (0.3); 1.506 (1.9); 1.477 (0.4); 1.469 (0.3); 1.276 (1.4); 1.266 (2.7); 1.257 (3.1); 1.235 (16.0); 0.871 (0.5); 0.854 (1.6); 0.837 (0.8); 0.008 (0.3); 0.000 (12.0); -0.008 (0.4)</p>
<p>实施例 I-15: <math>^1\text{H}</math> NMR (601.6 MHz, <math>\text{d}_6\text{-DMSO}</math>):</p> <p><math>\delta</math>= 9.761 (1.3); 9.598 (1.6); 9.582 (1.7); 8.883 (3.6); 8.769 (1.3); 8.314 (0.5); 8.112 (9.9); 8.102 (4.2); 8.082 (0.4); 7.766 (4.1); 7.749 (0.3); 7.397 (3.9); 6.286 (0.6); 6.271 (0.9); 6.256 (0.6); 3.972 (0.6); 3.969 (0.9); 3.951 (16.0); 3.866 (0.7); 3.849 (0.4); 3.846 (0.4); 3.840 (1.2); 3.808 (0.7); 3.805 (0.7); 3.796 (0.4); 3.790 (1.0); 3.776 (0.3); 3.339 (15.4); 2.731 (0.4); 2.617 (0.8); 2.614 (1.1); 2.611 (0.8); 2.608 (0.4); 2.541 (0.4); 2.523 (1.7); 2.520 (2.1); 2.517 (1.9); 2.508 (48.3); 2.505 (107.9); 2.502 (152.9); 2.499 (109.9); 2.496 (52.4); 2.392 (0.3); 2.389 (0.7); 2.386 (1.0); 2.383 (0.7); 2.380 (0.4); 1.989 (0.3); 1.853 (1.2); 1.847 (2.8); 1.841 (3.2); 1.834 (1.3); 1.398 (1.0); 1.270 (1.3); 1.264 (2.9); 1.257 (3.3); 1.251 (1.4); 1.236 (1.4); 0.005 (1.0); 0.000 (42.1); -0.006 (1.7)</p>
<p>实施例 I-16: <math>^1\text{H}</math> NMR (400.0 MHz, <math>\text{d}_6\text{-DMSO}</math>):</p> <p><math>\delta</math>= 9.762 (3.2); 9.737 (1.9); 8.883 (3.8); 8.777 (1.5); 8.338 (2.6); 8.316 (0.5); 8.113 (6.5); 8.084 (1.5); 7.887 (2.7); 7.866 (2.2); 7.764 (4.9); 7.399 (4.8); 6.378 (0.7); 6.356 (1.1); 6.334 (0.8); 3.947 (16.0); 3.324 (154.0); 2.728 (0.4); 2.676 (1.0); 2.671 (1.4); 2.667 (1.0); 2.541 (1.0); 2.524 (4.4); 2.511 (81.8); 2.506 (161.0); 2.502 (208.9); 2.498 (150.5); 2.333 (1.0); 2.329 (1.3); 2.324 (1.0); 1.989 (1.1); 1.858 (1.3); 1.847 (3.0); 1.838 (3.3); 1.829 (1.3); 1.398 (1.6); 1.273 (1.4); 1.263 (3.2); 1.254 (3.2); 1.243 (1.4); 1.236 (0.8); 1.193 (0.3); 1.175 (0.6); 0.000 (1.1)</p>
<p>实施例 I-17: <math>^1\text{H}</math> NMR (400.0 MHz, <math>\text{d}_6\text{-DMSO}</math>):</p> <p><math>\delta</math>= 9.779 (6.3); 9.755 (3.7); 8.879 (7.9); 8.774 (3.1); 8.317 (0.4); 8.282 (2.1); 8.264 (3.7); 8.245 (2.0); 8.127 (13.3); 7.817 (9.9); 7.407 (10.0); 6.396 (0.4); 6.377 (1.4); 6.356 (2.1); 6.333 (1.5); 6.312 (0.5); 4.544 (1.5); 4.527 (4.4); 4.509 (4.4); 4.492 (1.5); 3.333 (219.9); 2.677 (0.6); 2.672 (0.8); 2.668 (0.6); 2.542 (0.4); 2.525 (2.3); 2.512 (49.8); 2.508 (100.5); 2.503 (132.2); 2.499 (95.0); 2.495 (45.5); 2.335 (0.6); 2.330 (0.8); 2.325 (0.6); 2.076 (16.0); 1.858 (2.8); 1.849 (6.2); 1.839 (6.8); 1.830 (2.8); 1.273 (3.1); 1.263 (6.7); 1.254 (6.8); 1.244 (3.2); 1.234 (7.0); 1.217 (14.0); 1.199 (6.4); 0.008 (1.2); 0.000 (32.7); -0.009 (1.2)</p>
<p>实施例 I-18: <math>^1\text{H}</math> NMR (400.0 MHz, <math>\text{d}_6\text{-DMSO}</math>):</p> <p><math>\delta</math>= 9.774 (7.1); 9.751 (4.4); 8.875 (9.2); 8.767 (3.5); 8.316 (0.5); 8.281 (2.4); 8.263 (4.3); 8.244 (2.3); 8.124 (15.5); 7.815 (11.3); 7.406 (11.3); 6.396 (0.5); 6.376 (1.6); 6.355 (2.4); 6.333 (1.8); 6.311 (0.5); 4.544 (1.8); 4.527 (5.1); 4.509 (5.0); 4.491 (1.7); 3.325 (206.2); 2.676 (1.0); 2.671 (1.4); 2.667 (1.0); 2.542 (0.8); 2.525 (3.9); 2.511 (77.8); 2.507 (157.1); 2.502 (206.8); 2.498 (148.5); 2.494 (71.1); 2.334 (0.9); 2.329 (1.3); 2.325 (0.9); 2.075 (0.5); 1.858 (3.2); 1.848 (7.1); 1.839 (7.7); 1.829 (3.1); 1.273 (3.5); 1.263 (7.6); 1.254 (7.7); 1.243 (3.6); 1.234 (7.8); 1.216 (16.0); 1.199 (7.3); 0.146 (1.2); 0.008 (10.1); 0.000 (270.9); -0.009 (10.2); -0.150 (1.2)</p>
<p>实施例 I-19: <math>^1\text{H}</math> NMR (400.0 MHz, <math>\text{d}_6\text{-DMSO}</math>):</p> <p><math>\delta</math>= 9.844 (4.6); 9.820 (4.8); 9.774 (4.2); 8.898 (10.1); 8.791 (4.1); 8.332 (7.0); 8.317 (0.6); 8.154 (16.0); 8.103 (3.3); 8.082 (3.9); 7.893 (6.9); 7.872 (5.7); 7.840 (12.7); 7.477 (12.4); 6.414 (0.5); 6.393 (1.8); 6.371 (2.8); 6.348 (2.0); 6.326 (0.5); 5.492 (0.4); 5.486 (0.5); 5.442 (10.6); 5.399 (0.4); 5.393 (0.4); 4.056 (0.5); 4.038 (1.5); 4.020 (1.5); 4.003 (0.5); 3.325 (122.4); 3.212 (4.3); 3.206 (8.6); 3.200 (4.1); 2.676 (0.9); 2.671 (1.3); 2.507 (148.3); 2.502 (190.1); 2.498 (139.2); 2.329 (1.2); 1.989 (6.4); 1.862 (3.5); 1.851 (7.8); 1.843 (8.4); 1.833 (3.5); 1.397 (10.9); 1.275 (3.7); 1.265 (8.3); 1.257 (8.3); 1.246 (3.4); 1.236 (1.4); 1.193 (1.7); 1.175 (3.3); 1.157 (1.7); 0.146 (1.1); 0.007 (11.9); 0.000 (218.0); -0.008 (10.3); -0.150 (1.1)</p>
<p>实施例 I-20: <math>^1\text{H}</math> NMR (400.0 MHz, <math>\text{d}_6\text{-DMSO}</math>):</p> <p><math>\delta</math>= 9.767 (1.6); 9.634 (1.8); 9.609 (1.9); 8.889 (4.1); 8.777 (1.6); 8.154 (10.5); 8.117 (6.5); 7.769 (5.0); 7.401 (4.8); 6.313 (0.7); 6.292 (1.0); 6.270 (0.8); 3.951 (16.0); 3.328 (80.9); 3.309 (0.4); 2.672 (0.4);</p>

[0341]

2.525 (1.0); 2.507 (49.0); 2.503 (63.9); 2.499 (47.2); 2.330 (0.4); 1.860 (1.4); 1.849 (3.1); 1.840 (3.4); 1.831 (1.4); 1.275 (1.5); 1.266 (3.3); 1.256 (3.3); 1.246 (1.3); 0.008 (1.2); 0.000 (31.6); -0.008 (1.3)
实施例 I-21: $^1\text{H}$ NMR (400.0 MHz, $d_6$ -DMSO): $\delta$ = 9.775 (2.2); 9.715 (2.6); 9.691 (2.6); 8.901 (5.8); 8.789 (2.2); 8.316 (0.4); 8.156 (10.7); 8.147 (16.0); 7.844 (7.4); 7.483 (7.0); 6.326 (1.0); 6.304 (1.4); 6.282 (1.1); 5.445 (5.4); 5.442 (5.4); 3.326 (125.1); 3.221 (2.5); 3.215 (5.5); 3.209 (2.4); 2.676 (0.6); 2.672 (0.8); 2.667 (0.6); 2.525 (2.3); 2.512 (44.4); 2.507 (90.3); 2.503 (120.0); 2.498 (87.0); 2.493 (42.0); 2.334 (0.6); 2.329 (0.8); 2.325 (0.6); 1.909 (0.6); 1.862 (2.0); 1.852 (4.4); 1.843 (4.8); 1.833 (2.0); 1.277 (2.1); 1.267 (4.6); 1.258 (4.7); 1.247 (1.9); 1.235 (0.5); 0.008 (2.5); 0.000 (71.1); -0.009 (2.5)
实施例 I-22: $^1\text{H}$ NMR (400.0 MHz, $d_6$ -DMSO): $\delta$ = 9.799 (0.6); 9.769 (4.5); 9.751 (4.8); 9.727 (4.4); 9.289 (0.6); 8.870 (9.0); 8.769 (4.3); 8.316 (0.9); 8.267 (7.9); 8.231 (7.9); 8.128 (12.7); 8.110 (0.6); 7.992 (7.6); 7.859 (0.9); 7.848 (1.1); 7.803 (10.6); 7.720 (0.5); 7.387 (11.1); 7.318 (0.5); 6.444 (0.5); 6.423 (1.8); 6.402 (2.7); 6.380 (1.9); 6.358 (0.6); 4.540 (2.1); 4.524 (5.8); 4.506 (5.9); 4.489 (2.2); 4.353 (0.4); 4.335 (0.4); 3.979 (0.5); 3.421 (0.4); 3.323 (201.1); 3.031 (1.2); 2.773 (1.1); 2.672 (2.3); 2.565 (0.6); 2.506 (268.9); 2.503 (335.5); 2.329 (2.2); 1.858 (3.2); 1.848 (7.5); 1.839 (8.3); 1.831 (3.9); 1.585 (0.5); 1.580 (0.6); 1.364 (0.5); 1.347 (0.9); 1.329 (0.5); 1.315 (0.4); 1.298 (0.5); 1.272 (4.4); 1.262 (8.9); 1.253 (9.2); 1.236 (6.4); 1.226 (8.7); 1.208 (16.0); 1.191 (7.7); 0.921 (0.5); 0.904 (0.5); 0.854 (0.5); 0.146 (1.3); 0.000 (264.2); -0.059 (0.3); -0.150 (1.3)
实施例 I-23: $^1\text{H}$ NMR (400.0 MHz, $d_6$ -DMSO): $\delta$ = 9.767 (0.9); 9.397 (1.0); 9.374 (1.1); 8.868 (2.4); 8.782 (0.9); 8.103 (4.2); 7.785 (2.9); 7.389 (1.5); 7.373 (1.4); 7.368 (1.3); 7.354 (3.1); 7.301 (0.5); 7.284 (0.6); 7.278 (1.0); 7.273 (0.5); 7.261 (0.3); 7.255 (0.5); 6.403 (0.5); 6.392 (0.5); 4.550 (0.4); 4.532 (1.1); 4.513 (1.1); 4.495 (0.4); 3.326 (30.5); 2.525 (0.6); 2.511 (14.5); 2.507 (30.1); 2.502 (40.7); 2.498 (30.4); 2.493 (15.2); 1.989 (0.5); 1.858 (0.8); 1.847 (1.8); 1.838 (2.0); 1.829 (0.8); 1.398 (16.0); 1.273 (0.8); 1.263 (1.9); 1.254 (1.9); 1.243 (0.9); 1.225 (1.9); 1.208 (4.0); 1.190 (1.9); 1.175 (0.4); 0.008 (2.2); 0.000 (61.1); -0.009 (2.6)
实施例 I-24: $^1\text{H}$ NMR (400.0 MHz, $d_6$ -DMSO): $\delta$ = 9.766 (3.5); 9.406 (3.7); 9.383 (3.8); 8.869 (8.2); 8.779 (3.4); 8.316 (0.6); 8.110 (12.7); 7.831 (0.8); 7.785 (10.0); 7.711 (13.6); 7.707 (16.0); 7.655 (4.3); 7.651 (6.9); 7.646 (3.9); 7.353 (10.4); 6.553 (1.0); 6.544 (0.9); 6.416 (1.9); 6.406 (1.9); 6.279 (1.0); 6.268 (1.1); 5.703 (0.4); 5.693 (0.6); 5.671 (1.2); 5.665 (1.2); 5.650 (1.0); 5.636 (1.2); 5.612 (0.6); 5.603 (0.5); 4.545 (1.7); 4.528 (4.7); 4.510 (4.6); 4.492 (1.7); 3.326 (144.3); 3.030 (2.0); 2.774 (1.9); 2.671 (1.3); 2.667 (1.0); 2.506 (146.9); 2.502 (193.1); 2.498 (149.3); 2.333 (1.0); 2.329 (1.3); 2.325 (1.0); 1.857 (2.9); 1.847 (6.5); 1.838 (7.0); 1.828 (3.0); 1.397 (14.6); 1.272 (3.2); 1.262 (7.0); 1.253 (7.2); 1.242 (3.5); 1.223 (7.0); 1.205 (14.0); 1.188 (6.5); 0.146 (1.2); 0.008 (11.8); 0.000 (239.1); -0.008 (16.1); -0.150 (1.2)
实施例 I-25: $^1\text{H}$ NMR (400.0 MHz, $d_6$ -DMSO): $\delta$ = 9.763 (3.4); 9.419 (3.6); 9.396 (3.7); 8.864 (8.1); 8.777 (3.4); 8.316 (0.4); 8.101 (11.8); 8.036 (0.6); 7.952 (0.9); 7.907 (6.9); 7.903 (7.3); 7.812 (0.6); 7.781 (9.9); 7.727 (5.7); 7.707 (7.8); 7.596 (4.0); 7.592 (4.2); 7.575 (3.1); 7.571 (3.2); 7.340 (10.2); 6.540 (1.0); 6.530 (0.9); 6.403 (1.9); 6.393 (2.0); 6.265 (1.0); 6.254 (1.1); 5.756 (1.8); 5.667 (0.5); 5.657 (0.6); 5.633 (1.3); 5.625 (1.2); 5.612 (1.1); 5.600 (1.4); 5.577 (0.6); 5.566 (0.5); 4.543 (1.7); 4.526 (4.8); 4.508 (4.8); 4.491 (1.8); 4.056 (1.2); 4.038 (3.8); 4.020 (3.9); 4.002 (1.3); 3.325 (169.3); 2.980 (0.3); 2.891 (5.4); 2.732 (4.8); 2.690 (2.1); 2.671 (1.1); 2.506 (124.7); 2.502 (164.1); 2.498 (130.1); 2.329 (1.1); 1.989 (16.0); 1.857 (2.7); 1.847 (6.2); 1.838 (6.8); 1.828 (3.0); 1.335 (0.4); 1.327 (0.5); 1.272 (3.0); 1.262 (6.6); 1.253 (6.8); 1.243 (3.0); 1.220 (6.8); 1.203 (13.9); 1.193 (6.9); 1.185 (6.9); 1.175 (9.1); 1.157 (4.3); 1.006 (0.4); 0.999 (0.4); 0.146 (0.7); 0.000 (137.1); -0.150 (0.7)
实施例 I-26: $^1\text{H}$ NMR (400.0 MHz, $d_6$ -DMSO): $\delta$ = 9.813 (0.3); 9.784 (5.1); 9.775 (3.9); 9.760 (4.7); 9.298 (0.4); 8.877 (8.7); 8.769 (3.4); 8.317 (0.3); 8.126 (16.0); 8.108 (2.8); 8.094 (1.4); 7.865 (0.9); 7.861 (0.7); 7.817 (10.9); 7.409 (11.0); 6.393 (0.4); 6.373 (1.6); 6.351 (2.4); 6.329 (1.7); 6.308 (0.5); 4.546 (1.7); 4.528 (5.1); 4.511 (5.1); 4.493 (1.7); 3.327 (124.1); 2.676 (0.8); 2.672 (1.2); 2.667 (0.9); 2.525 (2.8); 2.511 (65.9); 2.507 (135.0); 2.503 (180.5); 2.498 (135.1); 2.494 (68.5); 2.334 (0.9); 2.329 (1.2); 2.325 (0.9); 2.075 (8.3); 1.858 (3.0); 1.848 (6.8); 1.839 (7.5); 1.830 (3.1); 1.589 (0.3); 1.582 (0.4); 1.286 (0.4); 1.273 (3.6); 1.263 (7.4); 1.254 (7.5); 1.243 (3.5); 1.234 (7.4); 1.216 (15.5); 1.199 (7.1); 0.000 (2.5)

[0342]



<p><b>实施例 I-27:</b> <math>^1\text{H NMR}</math> (400.0 MHz, <math>\text{d}_6\text{-DMSO}</math>):</p> <p><math>\delta = 9.784</math> (4.9); 9.773 (3.9); 9.761 (5.0); 8.876 (9.2); 8.776 (3.4); 8.317 (0.4); 8.122 (15.7); 8.113 (2.7); 8.098 (2.6); 8.089 (2.6); 8.074 (2.4); 7.816 (11.4); 7.406 (11.4); 6.416 (0.4); 6.395 (1.6); 6.374 (2.3); 6.352 (1.7); 6.331 (0.5); 4.546 (1.6); 4.528 (4.5); 4.510 (4.4); 4.492 (1.6); 3.327 (71.9); 2.677 (0.6); 2.672 (0.9); 2.668 (0.7); 2.526 (2.1); 2.521 (3.1); 2.512 (46.7); 2.508 (97.2); 2.503 (130.7); 2.499 (96.2); 2.494 (47.1); 2.335 (0.6); 2.330 (0.9); 2.326 (0.6); 2.076 (6.3); 1.859 (3.1); 1.849 (7.1); 1.840 (7.7); 1.830 (3.2); 1.274 (3.4); 1.264 (7.6); 1.255 (7.7); 1.244 (3.5); 1.234 (7.7); 1.217 (16.0); 1.199 (7.3); 0.146 (1.0); 0.008 (7.3); 0.000 (219.6); -0.009 (8.2); -0.150 (1.0)</p>
<p><b>实施例 I-28:</b> <math>^1\text{H NMR}</math> (400.0 MHz, <math>\text{d}_6\text{-DMSO}</math>):</p> <p><math>\delta = 9.771</math> (3.5); 9.513 (0.4); 9.491 (0.5); 9.466 (3.9); 9.444 (4.0); 9.293 (0.8); 8.871 (9.2); 8.776 (3.5); 8.317 (0.6); 8.109 (15.2); 8.064 (3.0); 8.045 (5.0); 8.027 (2.9); 7.847 (1.4); 7.836 (1.0); 7.792 (11.2); 7.351 (11.9); 6.626 (1.0); 6.616 (1.0); 6.488 (2.1); 6.478 (2.2); 6.351 (1.1); 6.340 (1.2); 5.885 (0.5); 5.875 (0.6); 5.853 (1.4); 5.843 (1.2); 5.833 (1.1); 5.820 (1.5); 5.798 (0.6); 5.787 (0.5); 4.559 (0.3); 4.541 (1.8); 4.523 (4.6); 4.504 (4.5); 4.486 (1.7); 4.468 (0.3); 3.329 (169.8); 2.676 (0.9); 2.672 (1.2); 2.667 (0.9); 2.525 (3.4); 2.511 (69.6); 2.507 (137.7); 2.503 (180.3); 2.498 (133.2); 2.494 (66.5); 2.334 (0.9); 2.330 (1.2); 2.325 (0.9); 1.857 (3.1); 1.847 (6.9); 1.838 (7.6); 1.829 (3.1); 1.586 (0.7); 1.579 (0.7); 1.286 (0.5); 1.271 (3.9); 1.262 (7.6); 1.252 (7.7); 1.242 (3.2); 1.223 (7.6); 1.205 (16.0); 1.188 (7.3); 0.146 (1.5); 0.008 (13.0); 0.000 (310.8); -0.008 (12.9); -0.150 (1.5)</p>
<p><b>实施例 I-29:</b> <math>^1\text{H NMR}</math> (400.0 MHz, <math>\text{d}_6\text{-DMSO}</math>):</p> <p><math>\delta = 9.801</math> (4.5); 9.777 (7.5); 8.876 (9.7); 8.770 (3.8); 8.165 (3.5); 8.152 (3.3); 8.149 (3.3); 8.127 (15.1); 7.817 (11.7); 7.408 (11.8); 6.410 (0.5); 6.391 (1.8); 6.369 (2.6); 6.348 (1.9); 6.327 (0.6); 4.545 (1.8); 4.528 (5.4); 4.510 (5.4); 4.492 (1.8); 3.325 (124.8); 2.675 (1.1); 2.671 (1.6); 2.667 (1.2); 2.506 (178.5); 2.502 (238.7); 2.498 (184.1); 2.329 (1.5); 2.325 (1.2); 2.075 (7.4); 1.857 (3.2); 1.847 (7.3); 1.838 (8.1); 1.829 (3.3); 1.272 (3.5); 1.262 (7.8); 1.253 (8.0); 1.243 (3.8); 1.233 (7.9); 1.216 (16.0); 1.198 (7.5); 0.000 (3.7)</p>
<p>[0343] <b>实施例 I-30:</b> <math>^1\text{H NMR}</math> (400.0 MHz, <math>\text{d}_6\text{-DMSO}</math>):</p> <p><math>\delta = 10.464</math> (3.7); 10.439 (4.0); 9.761 (4.2); 8.923 (9.7); 8.861 (4.3); 8.429 (3.4); 8.414 (3.3); 8.317 (0.4); 8.240 (16.0); 8.223 (2.6); 8.072 (0.5); 8.009 (13.1); 7.850 (0.4); 7.673 (2.6); 7.648 (3.8); 7.625 (2.5); 6.396 (0.5); 6.376 (1.7); 6.354 (2.6); 6.332 (1.8); 6.311 (0.5); 4.627 (2.0); 4.610 (5.7); 4.592 (5.8); 4.575 (2.0); 3.329 (286.3); 2.672 (1.7); 2.668 (1.4); 2.507 (207.0); 2.503 (266.8); 2.499 (207.6); 2.330 (1.7); 2.326 (1.3); 2.076 (3.7); 1.866 (3.2); 1.856 (7.5); 1.847 (8.2); 1.838 (3.6); 1.330 (7.8); 1.313 (16.0); 1.294 (8.9); 1.280 (8.3); 1.271 (8.1); 1.261 (3.4); 0.146 (0.7); 0.000 (138.4); -0.149 (0.7)</p>
<p><b>实施例 I-31:</b> <math>^1\text{H NMR}</math> (400.0 MHz, <math>\text{d}_6\text{-DMSO}</math>):</p> <p><math>\delta = 9.793</math> (2.5); 9.770 (4.0); 8.876 (5.2); 8.776 (2.0); 8.316 (0.5); 8.121 (8.8); 7.974 (0.9); 7.958 (1.0); 7.951 (1.0); 7.941 (0.9); 7.816 (6.4); 7.407 (6.4); 6.400 (0.9); 6.378 (1.3); 6.357 (1.0); 4.547 (0.9); 4.529 (2.6); 4.511 (2.6); 4.493 (0.9); 3.328 (149.6); 2.690 (16.0); 2.681 (0.5); 2.676 (0.8); 2.672 (1.0); 2.667 (0.7); 2.663 (0.4); 2.525 (2.4); 2.520 (3.8); 2.511 (53.7); 2.507 (109.4); 2.503 (145.0); 2.498 (106.4); 2.494 (52.3); 2.334 (0.7); 2.329 (0.9); 2.325 (0.7); 1.858 (1.8); 1.848 (4.0); 1.839 (4.4); 1.829 (1.8); 1.398 (4.0); 1.272 (1.9); 1.262 (4.3); 1.253 (4.4); 1.242 (2.1); 1.233 (4.5); 1.216 (9.0); 1.198 (4.1); 0.146 (1.2); 0.008 (9.0); 0.000 (251.3); -0.009 (9.9); -0.150 (1.1)</p>
<p><b>实施例 I-32:</b> <math>^1\text{H NMR}</math> (400.0 MHz, <math>\text{d}_6\text{-DMSO}</math>):</p> <p><math>\delta = 9.769</math> (3.6); 9.489 (4.2); 9.466 (4.4); 8.868 (9.5); 8.781 (3.6); 8.317 (0.4); 8.109 (15.9); 8.100 (0.6); 8.076 (3.3); 8.059 (3.2); 7.999 (1.6); 7.994 (1.7); 7.988 (1.9); 7.979 (2.2); 7.973 (1.9); 7.966 (1.9); 7.829 (0.7); 7.783 (11.7); 7.697 (0.9); 7.632 (2.7); 7.606 (3.5); 7.584 (2.5); 7.336 (11.8); 6.562 (1.1); 6.552 (1.0); 6.425 (2.2); 6.414 (2.2); 6.287 (1.1); 6.276 (1.2); 5.769 (0.5); 5.757 (3.8); 5.746 (0.7); 5.736 (1.4); 5.726 (1.1); 5.714 (1.1); 5.702 (1.4); 5.691 (0.7); 5.678 (0.6); 5.669 (0.5); 4.541 (1.8); 4.524 (5.0); 4.506 (5.0); 4.488 (1.8); 4.038 (0.5); 4.020 (0.5); 3.331 (173.5); 3.030 (2.2); 2.774 (1.9); 2.677 (0.7); 2.672 (1.0); 2.668 (0.8); 2.525 (2.5); 2.520 (3.9); 2.512 (55.0); 2.507 (111.8); 2.503 (148.3); 2.498 (109.8); 2.494 (54.5); 2.334 (0.7); 2.330 (1.0); 2.325 (0.7); 2.087 (15.4); 1.989 (2.0); 1.858 (3.2); 1.848 (7.3); 1.839 (7.8); 1.829 (3.2); 1.272 (3.4); 1.262 (7.7); 1.253 (7.8); 1.242 (3.5); 1.215 (7.6); 1.198 (16.0); 1.180 (7.3); 1.158 (0.7); 1.141 (0.5); 0.146 (1.3); 0.008 (9.8); 0.000 (266.0); -0.009 (10.6); -0.150 (1.3)</p>

[0344] a) 在酸性范围内通过LC-MS测定 $M^+$ 在pH 2.7下进行,乙腈(含有0.1%甲酸)和水作为洗脱剂;10%乙腈至95%乙腈线性梯度,仪器:Agilent 1100LC系统、Agilent MSD系统、HTS PAL。

[0345] 上述表和制备实施例中所报告的logP值根据EEC指令79/831Annex V.A8通过HPLC

(高效液相色谱法),使用反相柱(C18)来测定。温度43°C。用无支链的烷-2-酮(具有3至16个碳原子)来校准,其logP值是已知的。

[0346] b)  $^1\text{H}$  NMR数据用装备有流量探头(体积60 $\mu\text{L}$ )的BrukerAvance 400,以四甲基硅烷为基准(0.0)以及溶剂 $\text{CD}_3\text{CN}$ 、 $\text{CDCl}_3$ 、 $\text{D}_6$ -DMSO来测定。

[0347] 所选实施例的NMR数据以常规形式( $\delta$ 值,多重分裂,氢原子数)列出或以NMR峰值列表列出。

[0348] NMR峰值列表方法

[0349] 所选实施例的 $^1\text{H}$  NMR数据以 $^1\text{H}$  NMR峰值列表的形式说明。对于每个信号峰,首先列出以ppm为单位的 $\delta$ 值,然后是圆括号内的信号强度。对于不同信号峰值的 $\delta$ 值-信号强度对之间彼此以分号分隔列出。

[0350] 因此,一个实施例的峰列表采取以下形式:

[0351]  $\delta_1$ (强度 $_1$ ); $\delta_2$ (强度 $_2$ );.....; $\delta_i$ (强度 $_i$ );.....; $\delta_n$ (强度 $_n$ )

[0352] 在以cm为单位的NMR谱的展示的实施例中,尖峰信号的强度与信号的高度相关,其显示出信号强度的真实比例。对于宽峰信号,数个峰或中间信号及其相对强度可以与光谱中最强信号相比而示出。

[0353] 对于 $^1\text{H}$  NMR谱的化学位移的校准,使用四甲基硅烷和/或溶剂的化学位移,特别是在DMSO中测量的光谱的情况下。因此,四甲基硅烷峰可以但不需要出现在NMR峰列表中。

[0354]  $^1\text{H}$  NMR峰的列表类似于常规 $^1\text{H}$  NMR图谱,因此,其通常含有在常规NMR说明中列出的所有峰。

[0355] 另外,如同常规 $^1\text{H}$  NMR的图谱,其可显示出溶剂信号、目标化合物的立体异构体(其同样构成了本发明主题的一部分)的信号、和/或杂质的峰。

[0356] 在给出溶剂和/或水的 $\delta$ 范围内的化合物信号时,我们的 $^1\text{H}$  NMR峰的列表显示出通常的溶剂峰,例如在DMSO- $\text{D}_6$ 中的DMSO的峰和水的峰,这通常具有高的平均强度。

[0357] 所述目标化合物的立体异构体的峰和/或杂质的峰通常具有比所述目标化合物(例如具有>90%的纯度)的峰更低的平均强度。

[0358] 这些立体异构体和/或杂质可以是特定制备方法的特点。因此,在这种情况下,通过参考“副产品指纹”它们的峰可帮助识别我们的制备方法的再现性。

[0359] 如果需要的话,通过已知方法(Mestrec,ACD模拟,以及凭经验评估的预期值)计算目标化合物峰的专家可以任选地使用额外的强度过滤器分离出目标化合物的峰。这种分离类似于常规 $^1\text{H}$  NMR说明中相关的峰拾取。

[0360]  $^1\text{H}$  NMR峰列表的其他细节可以见于Research Disclosure Database Number564025。

[0361] 用途实施例

[0362] 下面的实施例证明了本发明的化合物的杀昆虫作用和杀螨作用。在这些实施例中,例举的本发明的化合物涉及表1中列出具有相应的参考标号(编号)的化合物:

[0363] 希伯来钝眼蜚(Amblyomma hebaraeum)测试

[0364] 溶剂:二甲基亚砜

[0365] 为制备合适的活性化合物制剂,将10mg的活性化合物与0.5ml的二甲基亚砜混合,并用水将该浓缩物稀释到所需浓度。

[0366] 将蜱若虫(Tick nymph) (*Amblyomma hebraeum*)放入有孔的塑料烧杯中,并浸在所需浓度中一分钟。在滤纸上将该蜱转移到有盖培养皿中,并保存在气候控制箱中。

[0367] 42天后,测定以%计的杀死率。100%表示所有蜱都已被杀死,0%表示没有蜱被杀死。

[0368] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100ppm下显示出100%功效:I-30。

[0369] 微小牛蜱(Boophilus microplus)-注射测试(BOOPMI注射)

[0370] 溶剂:二甲基亚砒

[0371] 为制备合适的活性化合物制剂,将10mg的活性化合物与0.5ml的溶剂混合,并用溶剂将该浓缩物稀释到所需浓度。

[0372] 将1 $\mu$ l的该活性化合物溶液注射到5个饱食的成年雌牛蜱(*Boophilus microplus*)的腹腔中。将这些动物转移到培养皿中,放在气候控制箱中。

[0373] 通过7天后能育卵的产卵数来评估功效。将没有明显能育性的卵储存在气候控制箱中,直到约42天后孵化出幼虫。100%功效表示没有蜱虫产出任何能育卵,0%功效表示所有卵都是能育的。

[0374] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为20 $\mu$ g/动物下显示出100%的功效:I-01、I-02、I-03、I-04、I-05、I-07、I-08、I-09、I-10、I-11、I-12、I-13、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-22、I-23、I-24、I-25、I-26、I-27、I-29、I-30、I-31、I-32。

[0375] 微小牛蜱-浸渍测试

[0376] 测试动物:牛蜱(*Boophilus microplus*) Parkhurst品系,SP-抗性

[0377] 溶剂:二甲基亚砒

[0378] 将10mg活性化合物溶解在0.5ml二甲基亚砒中。为了制备合适的制剂,在每种情况下均将活性化合物溶液用水稀释到所需浓度。

[0379] 将该活性化合物制剂吸移入试管中。将8-10个饱食的成年雌牛蜱(*Boophilus microplus*)转移到另一个带孔的试管中。将该试管浸渍在活性化合物制剂中,并使所有蜱虫完全浸润。所有液体挥发后,将蜱虫在滤盘上转移到塑料培养皿中,并储存在气候控制箱中。

[0380] 通过7天后能育卵的产卵数来评估功效。将没有明显能育性的卵储存在气候控制箱中,直到约42天后孵化出幼虫。100%功效表示没有牛蜱产出能育卵,0%功效表示所有卵都是能育的。

[0381] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为20ppm下显示出100%的功效:I-30。

[0382] 猫栉首蚤-经口测试(oral test) (CTECFE)

[0383] 溶剂:二甲基亚砒

[0384] 为了制备合适的活性化合物制剂,将10mg的活性化合物与0.5ml的二甲基亚砒混合。用柠檬酸牛血稀释,得到所需浓度。

[0385] 将约20个未进食的成年猫蚤(*Ctenocephalides felis*)放置到顶部和底部用纱布(gauze)密封的容器(chamber)内。将底部用石蜡膜密封的金属圆筒放置在容器上。圆筒中含有血液/活性化合物制剂,其可以被跳蚤透过石蜡膜而吸收。

[0386] 2天后,测定以%计的杀死率。100%表示所有跳蚤都已被杀死,0%表示没有跳蚤被杀死。

[0387] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100ppm下显示出100%的功效:I-01、I-02、I-03、I-04、I-05、I-07、I-08、I-09、I-10、I-11、I-12、I-13、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-22、I-23、I-24、I-25、I-26、I-27、I-29、I-30、I-31、I-32。

[0388] 铜绿蝇 (*Lucilia cuprina*) 测试 (LUCICU)

[0389] 溶剂:二甲基亚砷

[0390] 为了制备合适的活性化合物制剂,将10mg的活性化合物与0.5ml的二甲基亚砷混合,并用水将该浓缩物稀释到所需浓度。

[0391] 将约20只澳大利亚绵羊绿头蝇 (Australian sheep blowfly) (*Luciliacuprina*) 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测试容器中。

[0392] 2天后,测定以%计的杀死率。100%表示所有幼虫都已被杀死;0%表示没有幼虫被杀死。

[0393] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100ppm下显示出100%的功效:I-01、I-02、I-03、I-04、I-05、I-07、I-08、I-09、I-10、I-12、I-13、I-16、I-18、I-19、I-20、I-22、I-24、I-25、I-26、I-27、I-29、I-30、I-31、I-32。

[0394] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100ppm下显示出90%的功效:I-17、I-23。

[0395] 家蝇 (*Musca domestica*) 测试 (MUSCDO)

[0396] 溶剂:二甲基亚砷

[0397] 为制备合适的活性化合物制剂,将10mg的活性化合物与0.5ml的二甲基亚砷混合,并用水将该浓缩物稀释到所需浓度。

[0398] 在含有用糖溶液处理的海绵和所需浓度的活性化合物制剂的容器中放入10只成年家蝇 (*Musca domestica*)。

[0399] 2天后,测定以%计的杀死率。100%表示所有家蝇都已被杀死,0%表示没有家蝇被杀死。

[0400] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100ppm下显示出100%的功效:I-01、I-02、I-03、I-04、I-05、I-07、I-09、I-10、I-12、I-13、I-16、I-18、I-19、I-20、I-22、I-26、I-27、I-29、I-30、I-31。

[0401] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100ppm下显示出80%的功效:I-17、I-24。

[0402] 南方根结线虫 (*Meloidogyne incognita*) 测试

[0403] 溶剂:125.0重量份的丙酮

[0404] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物与规定量的溶剂混合,并将该浓缩物用水稀释至所需浓度。

[0405] 在容器内装入沙子、活性化合物溶液、南方根结线虫 (*Meloidogyne incognita*) 的卵/幼虫悬浮液和莴笋种子。莴笋种子发芽,并长成幼苗。虫瘿在根部发育。

[0406] 14天后,通过形成的虫瘿测定以%计的杀线虫功效。100%表示未发现虫瘿;0%表示经处理的植物上虫瘿数量等于在未处理的参照上的数量。

[0407] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为20ppm下显示出90%的功效:I-19。

[0408] 桃蚜(Myzus persicae)-喷洒测试

[0409] 溶剂:78重量份的丙酮

[0410] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0411] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0412] 为了制备合适的活性化合物制剂,使用规定重量份的溶剂来溶解1重量份的活性化合物,用含有浓度为1000ppm乳化剂的水调节至所需浓度。为了制备其他测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。

[0413] 在被所有阶段的绿桃蚜(Myzus persicae)侵染的大白菜(Brassica pekinensis)的叶片上喷洒具有所需浓度的活性化合物制剂。

[0414] 6天后,测定以%计的功效。100%表示所有蚜虫都已被杀死;0%表示没有蚜虫被杀死。

[0415] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100g/ha下显示出100%的功效:I-29。

[0416] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100g/ha下显示出90%的功效:I-20、I-32。

[0417] 辣根猿叶虫(Phaedon cochleariae)-喷洒测试(PHAECO)

[0418] 溶剂:78重量份的丙酮

[0419] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0420] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0421] 为了制备合适的活性化合物制剂,使用规定重量份的溶剂来溶解1重量份的活性化合物,用含有浓度为1000ppm乳化剂的水调节至所需浓度。为了制备其他测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。

[0422] 在大白菜(Brassica pekinensi)叶片上喷洒具有所需浓度的活性化合物制剂,并且干燥后,使辣根猿叶虫的幼虫栖居于叶片。

[0423] 7天后,测定以%计的功效。100%表示所有甲虫幼虫都已被杀死;0%表示没有甲虫幼虫被杀死。

[0424] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100g/h下显示出100%的功效:I-01、I-02、I-03、I-04、I-05、I-06、I-07、I-08、I-09、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-25、I-26、I-27、I-28、I-29、I-30、I-31、I-32。

[0425] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为20g/ha下显示出100%的功效:I-15。

[0426] 草地贪夜蛾(Spodoptera frugiperda)-喷洒测试(SPODFR)

[0427] 溶剂:78重量份的丙酮

[0428] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0429] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0430] 为了制备合适的活性化合物制剂,使用规定重量份的溶剂来溶解1重量份的活性

化合物,用含有浓度为1000ppm乳化剂的水调节至所需浓度。为了制备其他测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。

[0431] 在玉米 (*Zea mays*) 叶片上喷洒具有所需浓度的活性化合物制剂,并在干燥后,使夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*) 的毛虫栖居于叶片。

[0432] 7天后,测定以%计的功效。100%表示所有毛虫都已被杀死;0%表示没有毛虫被杀死。

[0433] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100g/ha下显示出100%的功效:I-01、I-02、I-03、I-04、I-05、I-06、I-07、I-08、I-09、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-24、I-25、I-26、I-27、I-28、I-29、I-30、I-31、I-32。

[0434] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100g/ha下显示出83%的效力:I-23。

[0435] 二斑叶螨 (*Tetranychus urticae*) - 喷洒测试、OP-抗性 (TETRUR)

[0436] 溶剂:78重量份的丙酮

[0437] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0438] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0439] 为了制备合适的活性化合物制剂,使用规定重量份的溶剂来溶解1重量份的活性化合物,用含有浓度为1000ppm乳化剂的水调节至所需浓度。为了制备其他测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。

[0440] 在被各阶段的二斑叶螨 (*Tetranychus urticae*) 侵染的菜豆 (*Phaseolus vulgaris*) 叶片上喷洒具有所需浓度的活性化合物制剂。

[0441] 6天后,测定以%计的功效。100%表示所有叶螨都已被杀死;0%表示没有叶螨被杀死。

[0442] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100g/ha下显示出100%的功效:I-01、I-02、I-04、I-06、I-07、I-08、I-09、I-10、I-11、I-13、I-14、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-25、I-26、I-27、I-28、I-30、I-31、I-32。

[0443] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100g/ha下显示出90%的功效:I-03、I-05、I-15、I-29。

[0444] 草地贪夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*) - 喷洒测试 (SPODFR)

[0445] 溶剂:78重量份的丙酮

[0446] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0447] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0448] 为了制备合适的活性化合物制剂,使用规定重量份的溶剂来溶解1重量份的活性化合物,用含有浓度为1000ppm乳化剂的水调节至所需浓度。为了制备其他测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。

[0449] 在玉米 (*Zea mays*) 叶片上喷洒具有所需浓度的活性化合物制剂,并在干燥后,使夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*) 的毛虫栖居于叶片。

[0450] 在所需的时间期间后,测定以%计的功效。100%表示所有毛虫都已被杀死;0%表示没有毛虫被杀死。

[0451] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物相对于现有技术表现了优异的功效:见表2。

[0452] 西花蓟马(Frankliniella occidentalis)-喷雾测试(FRANOC)

[0453] 溶剂:7重量份的二甲基甲酰胺

[0454] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0455] 为了制备合适的活性化合物制剂,使用规定重量份的溶剂来溶解1重量份的活性化合物,用含有浓度为1000ppm乳化剂的水调节至所需浓度。为了制备其他测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。如果需要加入铵盐或/和渗透剂,则将其各自以1000ppm的浓度加入到制剂溶液中。

[0456] 在矮菜豆植物叶片上喷洒具有所需浓度的活性化合物制剂。干燥后,将处理的植物用混合的蓟马种群(*Frankliniella occidentalis*)侵染。

[0457] 在所需的时间期间后,测定以%计的植物保护功效。100%表示没有明显的损害;0%表示对处理的植物的损害相当于对未处理的对照的损害。

[0458] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物相对于现有技术表现了优异的功效:见表2。

[0459] 带斑黄瓜条叶甲(Diabrotica balteata)-浸液测试(DIABBA)

[0460] 溶剂:7重量份的二甲基甲酰胺

[0461] 乳化剂:2重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

[0462] 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与规定量的溶剂和乳化剂混合,并将浓缩物用水稀释至所需浓度,必须将湿透的土壤体积计算在内。应确保不超过土壤中40ppm的乳化剂浓度。为制备其他测试浓度,用水进行稀释。

[0463] 在各个情况下,将5个玉米(*Zea mays*)播种到填有土的盆中,第二天盆用所需浓度的活性化合物制剂浇水。一天后,加入带斑黄瓜甲虫(*Diabrotica balteata*)的25只L2幼虫。

[0464] 8天后,测定以%计的功效。100%表示5个植株均已经发芽并生长;0%表示没有植株出苗。

[0465] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物相对于现有技术表现了优异的功效:见表2。

[0466] 二斑叶螨(Tetranychus urticae)-喷雾测试、OP-抗性(TETRUR)

[0467] 溶剂:78重量份的丙酮

[0468] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0469] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0470] 为了制备合适的活性化合物制剂,使用规定重量份的溶剂来溶解1重量份的活性化合物,用含有浓度为1000ppm乳化剂的水调节至所需浓度。为了制备其他测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。

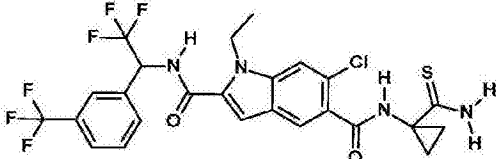
[0471] 在被各阶段的二斑叶螨侵染的菜豆(*Phaseolus vulgaris*)叶片上喷洒具有所需浓度的活性化合物制剂。

[0472] 在所需的时间期间后,测定以%计的功效。100%表示所有叶螨都被杀死;0%表示没有叶螨被杀死。

[0473] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物相对于现有技术表现了优异的功效:见表2。

[0474] 表2:

[0475]

物质	动物物种	浓度	功效% dat <sup>a)</sup>
 现有技术 化合物编号 273 WO-A-2012/119984	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
	SPODFR	0.8 g/ha	33 7dat
	FRANOC	4 ppm	98 7dat
	FRANOC	0.8 ppm	60 7dat
	DIABBA	20 ppm	60 8dat
	DIABBA	4 ppm	0 8dat
	TETRUR	20 g/ha	100 6dat
	TETRUR	4 g/ha	70 6dat
	实施例编号 I-01	SPODFR	4 g/ha
本发明	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
实施例编号 I-02	SPODFR	4 g/ha	100 7dat



[0476]

物质	动物物种	浓度	功效% dat <sup>a)</sup>
本发明	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
实施例编号 I-03	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
本发明	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
实施例编号 I-04	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
本发明	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
实施例编号 I-06	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
本发明	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
实施例编号 I-07	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
本发明	SPODFR	0.8 g/ha	67 7dat
实施例编号 I-08	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
本发明	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
实施例编号 I-10	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
本发明	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
实施例编号 I-12	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
本发明	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
实施例编号 I-15	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
本发明	SPODFR	0.8 g/ha	83 7dat
实施例编号 I-16	FRANOC	4 ppm	90 7dat
本发明	FRANOC	0.8 ppm	90 7dat
	DIABBA	20 ppm	100 8dat
	DIABBA	4 ppm	50 8dat
实施例编号 I-18	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
本发明	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat

[0477]

物质	动物物种	浓度	功效% dat <sup>a)</sup>
实施例编号 I-19 本发明	DIABBA	20 ppm	100 8dat
实施例编号 I-20 本发明	SPODFR SPODFR	4 g/ha 0.8 g/ha	100 7dat 100 7dat
实施例编号 I-21 本发明	SPODFR SPODFR	4 g/ha 0.8 g/ha	100 7dat 100 7dat
实施例编号 I-22 本发明	SPODFR SPODFR TETRUR TETRUR DIABBA DIABBA	4 g/ha 0.8 g/ha 20 g/ha 4 g/ha 20 ppm 4 ppm	100 7dat 100 7dat 100 6dat 100 6dat 100 8dat 50 8dat

[0478] a) 缩写: dat = 处理后的天数。

[0479] 该表显示出, 本发明的化合物相对于由W0-A-2012/119984已知的化合物编号273具有优异的生物功效, 特别是在低施用浓度下。

[0480] 当将W0-A-2012/119984的化合物编号273与本发明的化合物编号I-03和编号I-07比较时, 这变得特别明显, 本发明的化合物编号I-03和编号I-07与W0-A-2012/119984的化合物编号273的不同仅在于本发明的化合物在苯环的4位上额外地被 $R^1 = F$  (化合物编号I-03) 或 $R^1 = Cl$  (化合物编号I-07) 取代。生物活性的比较示出了最近发现的一组化合物的优越性。

[0481] 类似地, 这也适用于W0-A-2012/119984的化合物编号273与本发明的化合物编号I-10和编号I-22的比较, 它们的区别仅在于本发明的化合物在苯环上除了被 $-CF_3$ 取代, 还被卤素取代。

[0482] 类似地, 这还适用于W0-A-2012/119984的化合物编号273与本发明的化合物编号I-16和编号I-19的比较, 它们的区别仅在于本发明的化合物在苯环的4位上额外地被 $R^1 = Cl$ 取代, 且其中 $R^4$ 不是乙基而是甲基 (化合物编号I-16) 或丙-2-炔-1-基 (化合物编号I-19)。