

[12] 发明专利申请公开说明书

[21]申请号 95105445.7

[51]Int.Cl⁶

C07D401/04

[43]公开日 1995年12月13日

[22]申请日 95.4.28

[30]优先权

[32]94.4.29 [33]DE[31]P4414974.3

[71]申请人 拜尔公司

地址 联邦德国莱沃库森

[72]发明人 R·富斯

C·艾尔德伦

[74]专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 罗宏 王景朝

A01N 47/38

说明书页数:

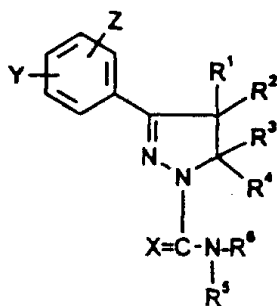
附图页数:

[54]发明名称 取代的吡唑啉衍生物

[57]摘要

本发明涉及新的取代的吡唑啉衍生物, 它们的制法及作为杀虫剂的应用, 特别是作为杀昆虫剂和杀螨剂的应用, 所述新的化合物有上列通式。

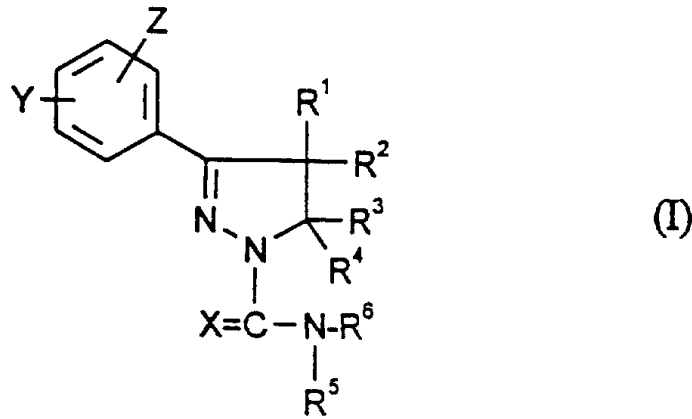
其中各代号意义详见说明书。



(I)

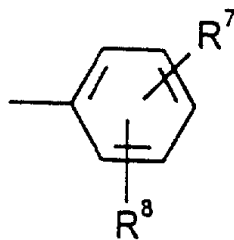
(BJ)第 1456 号

1. 式 (I) 的新的取代的吡唑啉衍生物:



其中

- R¹ 代表不饱和的五元的、任选取代或任选苯稠合的含 1 至 4 个氮原子的杂环;
- R² 代表氢、烷基、任选取代的环烷基、卤代烷基、卤代烷硫基、烷氧羰基或三烷基甲硅烷基;
- R³ 代表氢或烷基;
- R⁴ 代表氢或烷基;
- R⁵ 代表氰基或各自任选取代的烷基、环烷基、链烯基或炔基, 或代表甲酰基, 或各自任选取代的烷基羰基或烷氧羰基;
- R⁶ 代表任选取代的烷基、任选取代的环烷基或下式基团:



其中 R⁷ 和 R⁸ 可相同或不相同，并代表氢、卤素、烷基、硝基、氰基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷硫基、卤代烷硫基、各自任选取代的苯氧基或苯硫基、任选取代的单或双烷基氨基、任选取代的环烷基、烷氧羰基、链烯基、炔基、烷基亚硫酰基、烷基磺酰基、卤代烷基亚硫酰基、卤代烷基磺酰基、卤代烷氧羰基，或

R⁷ 和 R⁸ 一起代表两价的含有一个或二个氧原子的任选取代的基团：

X 代表氧或硫；和

Y 和 Z 各自独立地代表氢、烷基、卤素、卤代烷基、烷氧基、烷硫基、卤代烷氧基、卤代烷硫基、烷氧羰基、卤代烷氧羰基、各自任选取代芳氧基或芳硫基、链烯基、炔基、烷基亚硫酰基、烷基磺酰基、卤代烷基亚硫酰基、卤代烷基磺酰基、氨基、任选取代的单或双烷基氨基、硝基或氰基，或

Y 和 Z 一起代表都为卤素任选取代的 3, 4 - 亚甲二氧基或 3, 4 - 亚乙二氧基。

2. 按权利要求 1 的式 (I) 的取代的吡唑啉衍生物，其中，

R¹ 代表 1 H - 吡咯 - 1 - 基、1 H - 吡唑 - 1 - 基、1 H - 咪唑 - 1 - 基、2 H - 1, 2, 3 - 三唑 - 2 - 基、1 H - 1, 2, 3 - 三唑 - 1 - 基、1 H - 1, 2, 4 - 三唑 - 1 - 基、4 H - 1, 2, 4 - 三唑 - 4 - 基、2 H - 四唑 - 2 - 基或 1 H - 四唑 - 1 - 基，它们任选被选自下列基团的相同或不相同取代基单取代或多取代：卤素、烷基 (C₁ - C₆)、CN、NO₂、烷氧基 (C₁ - C₆) 羰基、烷基 (C₁ - C₆)

硫基、烷氧基 (C₁ - C₆)、卤代烷基 (C₁ - C₄)、
卤代烷 (C₁ - C₄) 硫基、卤代烷氧基 (C₁ - C₄)、
氨基、单或双烷基 (C₁ - C₄) 氨基或卤代烷氧基 (C₁ - C₆) 羰基，

R² 代表氢、烷基 (C₁ - C₆)、任选被卤素或卤代烷基 (C₁ - C₄) 取代的环烷基 (C₃ - C₇)；或代表卤代烷基 (C₁ - C₄)、卤代烷 (C₁ - C₄) 硫基、烷氧基 (C₁ - C₆) 羰基或三烷基 (C₁ - C₆) 甲硅烷基，

R³ 代表氢或烷基 (C₁ - C₆)，

R⁴ 代表氢或烷基 (C₁ - C₆)，

R⁵ 代表氰基、任选被卤素、烷氧基 (C₁ - C₆) 或下列基团之一取代的烷基 (C₁ - C₁₀)：



其中

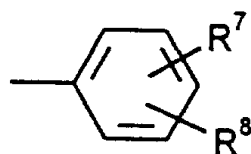
R⁷ 代表任选被卤素取代的烷基 (C₁ - C₁₀)；

R⁸ 和 R⁹ 相同或不相同，并代表烷基 (C₁ - C₁₀)，或

R⁸ 和 R⁹ 共同与和它们键合在一起的氮原子构成任选还再含一个杂原子的 3 至 8 元环，

或代表被卤素或卤代烷基 (C₁ - C₆) 任选取代的环烷基 (C₃ - C₈)、任选被卤素或烷氧基 (C₁ - C₆) 取代的链烯基 (C₂ - C₈) 或炔基 (C₂ - C₈)、甲酰基、任选被卤素取代的烷基 (C₁ - C₁₀) 羰基或任选被卤素取代的烷氧 (C₁ - C₁₀) 羰基，

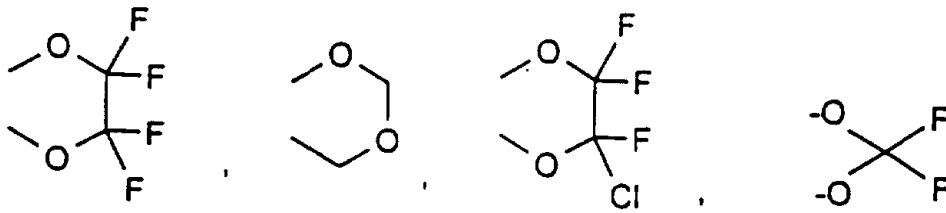
R^6 代表任选被卤素或卤代烷氧基 ($C_1 - C_4$) 取代的烷基 ($C_1 - C_6$)、或优选代表任选被卤素、卤代烷基 ($C_1 - C_4$) 或卤代烷氧基 ($C_1 - C_4$) 取代的环烷基 ($C_3 - C_7$)，或下式基团



其中

R^7 和 R^8 相同或不相同，并代表氢、卤素、烷基 ($C_1 - C_6$)、硝基、氰基、卤代烷基 ($C_1 - C_6$)、烷氧基 ($C_1 - C_6$)、卤代烷氧基 ($C_1 - C_6$)、烷 ($C_1 - C_6$) 硫基、卤代烷 ($C_1 - C_6$) 硫基、或各自任选被卤素、卤代烷基 ($C_1 - C_6$)、烷氧基 ($C_1 - C_6$) 或烷基 ($C_1 - C_6$) 取代的苯氧基或苯硫基、任选被卤素或烷氧基 ($C_1 - C_4$) 取代且各自在烷基部分含 1 至 6 个碳原子的单或双烷基氮在、任选被烷基 ($C_1 - C_4$)、烷氧基 ($C_1 - C_4$)、卤素、或烷 ($C_1 - C_4$) 硫基取代的环烷基 ($C_3 - C_7$)、烷氧 ($C_1 - C_6$) 羰基、链烯基 ($C_2 - C_6$)、炔基 ($C_2 - C_6$)、烷 ($C_1 - C_4$) 亚硫酰基、烷 ($C_1 - C_4$) 磺酰基、卤代烷 ($C_1 - C_4$) 亚硫酰基、卤代烷 ($C_1 - C_4$) 磺酰基或卤代烷氧 ($C_1 - C_4$) 羰基或其中

R^7 和 R^8 一起代表下列二价基团中的一个：



X 代表氧或硫，

Y 和 Z 各自独立地代表氢、烷基 (C₁ - C₆)、卤素、卤代烷基 (C₁ - C₆)、烷氧基 (C₁ - C₆)、烷 (C₁ - C₆) 硫基、卤代烷氧基 (C₁ - C₆)、卤代烷 (C₁ - C₆) 硫基、烷氧 (C₁ - C₄) 羰基、卤代烷氧 (C₁ - C₄) 羰基、任选被卤素、烷基 (C₁ - C₄)、烷氧基 (C₁ - C₄) 或卤代烷基 (C₁ - C₄) 取代的苯氧基或苯硫基、链烯基 (C₂ - C₆)、炔基 (C₂ - C₆)、烷基 (C₁ - C₄) 亚硫酰基、烷基 (C₁ - C₄) 磺酰基、卤代烷基 (C₁ - C₄) 亚硫酰基、卤代烷基 (C₁ - C₄) 磺酰基、任选被卤素或烷氧基 (C₁ - C₄) 取代的单或双烷基 (C₁ - C₆) 氨基、硝基或氰基，或

Y 和 Z 一起代表任选被氟和/或氯取代的 3,4-亚甲二氧基或 3,4-亚乙二氧基。

3. 按权利要求 1 的式 (I) 的取代的吡唑啉衍生物，其中

R¹ 代表 1H-吡咯-1-基、1H-吡唑-1-基、1H-咪唑-1-基、2H-1,2,3-三唑-2-基、1H-1,2,3-三唑-1-基、1H-1,2,4-三唑-1-基、4H-1,2,4-三唑-4-基、2H-四唑-2-基或 1H-四唑-1-基基团，它们任选被选自下列基团的相同或不相

同取代基单取代或双取代：氟、氯、溴、碘、烷基（ $C_1 - C_4$ ）、 CN 、 NO_2 、烷氧（ $C_1 - C_4$ ）羰基、烷（ $C_1 - C_3$ ）硫基、烷氧基（ $C_1 - C_4$ ）、卤代烷基（ $C_1 - C_3$ ）、卤代烷（ $C_1 - C_3$ ）硫基、氨基或双烷基（ $C_1 - C_3$ ）氨基或卤代烷氧（ $C_1 - C_4$ ）羰基，

R^2 代表氢、烷基（ $C_1 - C_4$ ）、任选被氟、氯、溴、或卤代烷基（ $C_1 - C_3$ ）取代的环烷基（ $C_3 - C_6$ ）、卤代烷基（ $C_1 - C_3$ ）、卤代烷（ $C_1 - C_3$ ）硫基、烷氧（ $C_1 - C_4$ ）羰基或三烷基（ $C_1 - C_4$ ）甲硅烷基，

R^3 代表氢或烷基（ $C_1 - C_4$ ），

R^4 代表氢或烷基（ $C_1 - C_4$ ），

R^5 代表氟基、任选被氟、氯、溴、烷氧基（ $C_1 - C_4$ ）或下列基团之一取代的烷基（ $C_1 - C_8$ ）：



其中

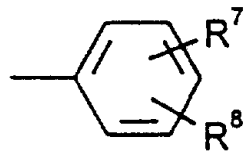
R^7 代表任选被氟、氯和/或溴取代的烷基（ $C_1 - C_8$ ）；

R^8 和 R^9 相同或不相同，并代表烷基（ $C_1 - C_8$ ），或者共同与和它们相键合的氮原子一起构成任选含有一个氧原子的 3 至 7 元环；

或代表被氟、氯、溴或卤代烷基（ $C_1 - C_4$ ）取代的环烷基（ $C_3 - C_6$ ）、任选被氟、氯、溴或烷氧基（ $C_1 - C_4$ ）取代的链烯基（ $C_3 - C_7$ ）或炔基（ $C_3 - C_7$ ）、甲酰基、各自任选被氟、氯和/或溴取代的烷基（ $C_1 - C_8$ ）

羧基或烷氧基 (C₁ - C₆) 羧基,

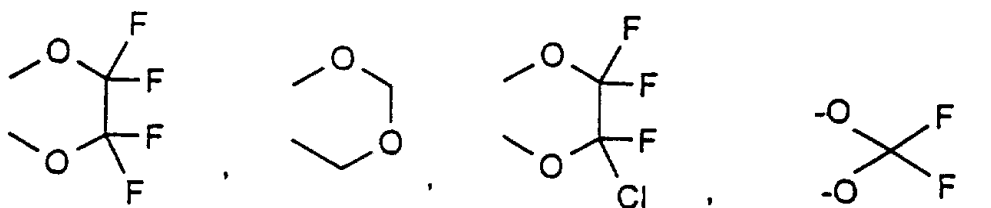
R⁶ 代表任选被氟、氯、溴或烷氧基 (C₁ - C₃) 取代的烷基 (C₁ - C₆)、任选被氟、氯、溴、烷氧基 (C₁ - C₃) 或烷氧基 (C₁ - C₃) 取代的环烷基 (C₃ - C₆)，或下列基团



其中

R⁷ 和 R⁸ 相同或不相同，并代表氢、氟、氯、溴、碘、烷基 (C₁ - C₄)、硝基、氰基、烷氧基 (C₁ - C₃)、烷氧基 (C₁ - C₄)、烷氧基 (C₁ - C₃)、烷 (C₁ - C₃) 硫基、烷 (C₁ - C₃) 硫基、任选被氟、氯、溴、烷氧基 (C₁ - C₃)、烷氧基 (C₁ - C₃) 或烷基 (C₁ - C₃) 取代的苯氧基、任选被氟、氯、溴或烷氧基 (C₁ - C₃) 取代且各自在烷基部分含 1 至 4 个碳原子的单或双烷基氨基、任选被烷基 (C₁ - C₃)、烷氧基 (C₁ - C₃)、氟、氯、溴或烷 (C₁ - C₃) 硫基取代的环烷基 (C₃ - C₆)、或其中

R⁷ 和 R⁸ 一起代表下列二价基团：



X代表氧或硫，

Y和Z各自独立地代表氢、烷基(C₁-C₄)、氟、氯、溴、碘、卤代烷基(C₁-C₄)、烷氧基(C₁-C₄)、烷(C₁-C₄)硫基、卤代烷氧基(C₁-C₃)、卤代烷基(C₁-C₃)硫基、烷氧(C₁-C₃)羰基、任选被氟、氯、溴、烷基(C₁-C₃)、烷氧基(C₁-C₃)或卤代烷基(C₁-C₃)取代的苯氧基或苯硫基、卤代烷氧(C₁-C₃)羰基、链烯基(C₂-C₄)、炔基(C₂-C₄)、烷基(C₁-C₃)亚硫酰基、烷基(C₁-C₃)磺酰基、卤代烷基(C₁-C₃)磺酰基、任选被卤素或烷氧基(C₁-C₃)取代的单或双烷基(C₁-C₃)氨基、硝基或氰基，或

Y和Z一起代表任选被氟和/或氯取代的3,4-亚甲二氧基或3,4-亚乙二氧基。

4. 按权利要求1的式(I)的取代的吡唑啉衍生物，其中

R¹代表1H-吡咯-1-基、1H-吡唑-1-基、1H-咪唑-1-基、2H-1,2,3-三唑-2-基、1H-1,2,3-三唑-1-基、1H-1,2,4-三唑-1-基、4H-1,2,4-三唑-4-基、2H-四唑-2-基或1H-四唑-1-基，任选被选自下列基团的相同或不相同取代基单取代或二取代：氟、溴、碘、烷基(C₁-C₃)、CN、NO₂、烷氧(C₁-C₃)羰基、烷(C₁-C₂)硫基、烷氧基(C₁-C₃)、卤代烷基(C₁-C₃)、卤代烷(C₁-C₂)硫基、双烷基(C₁-C₂)氨基或

卤代烷氧 (C₁ - C₃) 羰基;

R² 代表氢、烷基 (C₁ - C₃)、卤代烷基 (C₁ - C₂)、

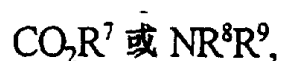
烷氧 (C₁ - C₃) 羰基或三烷基 (C₁ - C₃) 甲硅烷基;

R³ 代表氢、甲基、乙基或丙基;

R⁴ 代表氢、甲基、乙基或丙基;

R⁵ 代表氟基、任选被下列取代基取代的烷基 (C₁ - C₆):

氟、氯、烷氧基 (C₁ - C₃) 或下列基团之一:



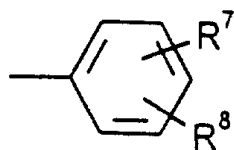
其中

R⁷ 代表任选被氟和/或氯取代的烷基 (C₁ - C₆);

R⁸ 和 R⁹ 相同或不相同, 并代表烷基 (C₁ - C₆), 或
与它们键合的氮原子一起形成任选含 1 个氧原子的
5 或 6 元环;

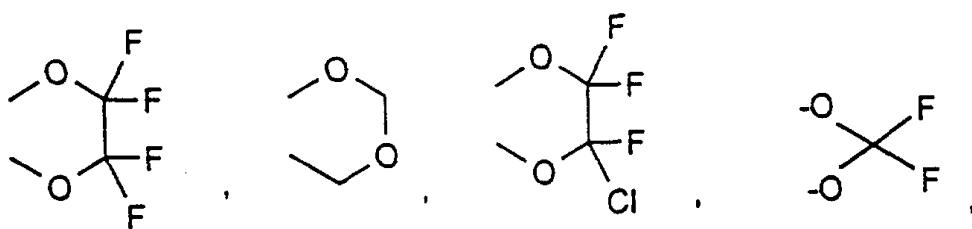
或代表任选被氟、氯或卤代烷基 (C₁ - C₃) 取代的含 3、5
或 6 个碳原子的环烷基、任选被氟、氯或烷氧基 (C₁ -
C₃) 取代的链烯基 (C₃ - C₆) 或炔基 (C₃ - C₆)、
甲酰基、任选被氟和/或氯取代的烷基 (C₁ - C₆) 羰
基或烷氧基 (C₁ - C₆) 羰基;

R⁶ 代表任选被氟、氯、卤代烷基 (C₁ - C₃) 或卤代烷氧基
(C₁ - C₂) 取代的环烷基 (C₃ - C₆) 或下列基团:



其中

R^7 和 R^8 相同或不相同，并代表氢、氟、氯、溴、烷基 ($C_1 - C_3$)、硝基、氰基、卤代烷基 ($C_1 - C_3$)、烷氧基 ($C_1 - C_3$)、卤代烷氧基 ($C_1 - C_2$)、烷 ($C_1 - C_2$) 硫基或卤代烷 ($C_1 - C_2$) 硫基、任选被氟、氯、溴、卤代烷基 ($C_1 - C_2$)、烷氧基 ($C_1 - C_2$) 或烷基 ($C_1 - C_2$) 取代的苯氧基、任选被氟、氯或烷氧基 ($C_1 - C_3$) 取代且各自在烷基部分含 1 至 3 个碳原子的单或双烷基氨基、任选被烷基 ($C_1 - C_2$)、烷氧基 ($C_1 - C_2$)、氟、氯或烷 ($C_1 - C_2$) 硫基取代含 3、5 或 6 个碳原子的环烷基，或 R^7 和 R^8 一起代表下列二价基团中的一个：



X 代表氧或硫；

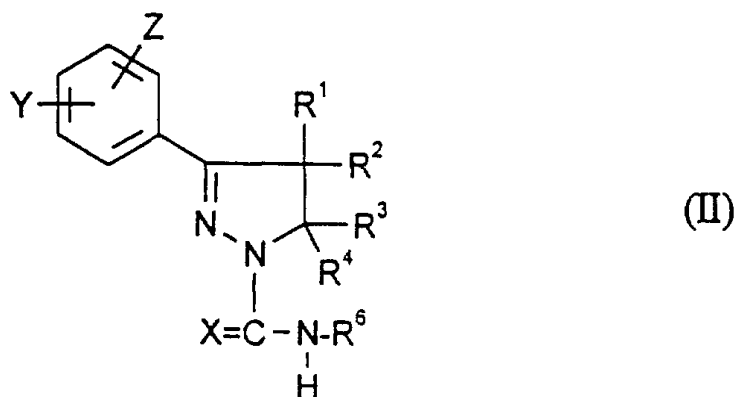
Y 和 Z 各自独立地代表氢、烷基 ($C_1 - C_3$)、氟、氯、溴、卤代烷基 ($C_1 - C_3$)、烷氧基 ($C_1 - C_3$)、烷 ($C_1 - C_3$) 硫基、卤代烷氧基 ($C_1 - C_2$)、卤代烷 ($C_1 - C_2$) 硫基、烷氧 ($C_1 - C_2$) 羰基、任选被氟、氯、溴、烷基 ($C_1 - C_3$)、烷氧基 ($C_1 - C_3$) 或卤代烷基 ($C_1 - C_3$) 取代的苯氧基、卤代烷氧 ($C_1 - C_2$) 羰基、链烯基 ($C_2 - C_4$)、烷基 ($C_1 - C_3$) 亚硫酰基、烷基 (C_1

-C₃) 磺酰基、卤代烷基 (C₁ - C₃) 磺酰基、任选被氟、氯或烷氧基 (C₁ - C₂) 取代的单或双烷基 (C₁ - C₃) 氨基、硝基、氰基；或

Y 和 Z 一起代表任选被氟和/或氯取代的 3,4-亚甲二氧基或 3,4-亚乙二氧基。

5. 按权利要求 1 的式 (I) 的取代的吡唑啉衍生物的制备方法，包括

a) 在碱存在下，并且适宜时在稀释剂存在下，使式 (II) 的取代的吡唑啉衍生物与式 (III) 化合物反应，



式 (II) 中，

R¹、R²、R³、R⁴、R⁶、X、Y 和 Z 具有前述意义；

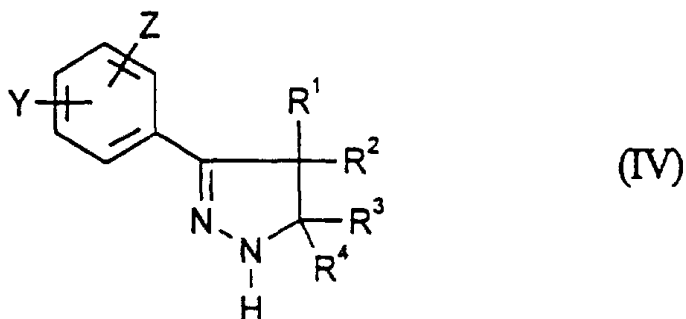


式 (III) 中，

R⁵ 具有前述意义，和

A 代表适宜的离去基团；或

b) 适宜时在碱存在下，且适宜时在稀释剂存在下，使式 (IV) 的取代的吡唑啉衍生物与式 (V) 的化合物反应，



式 (IV) 中，

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、Y 和 Z 具有前述意义；



式 (V) 中，

R^5 和 R^6 具有前述意义。

6. 包含至少一种按权利要求 1 的式 (I) 的取代的吡唑啉衍生物的杀虫剂。

7. 按权利要求 1 的式 (I) 的取代的吡唑啉衍生物用于清除害虫的应用。

8. 清除害虫的方法，包括使权利要求 1 的式 (I) 的取代的吡唑啉衍生物作用于害虫和/或其环境上。

9. 制备杀虫剂的方法，包括混合按权利要求 1 的式 (I) 的取代的吡唑啉衍生物和稀释剂和/或表面活性剂。

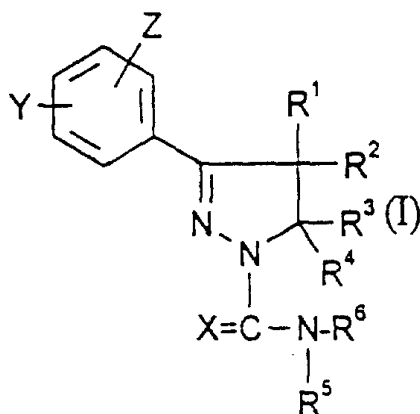
取代的吡唑啉衍生物

本发明涉及新的取代的吡唑啉衍生物，它们的制法，还涉及它们作为杀虫剂的应用。

已知某些取代的吡唑啉衍生物具有抗动物害虫的活性，如 N - (4 - 三氟甲氧基) - 3 - (4' - 氯苯基) - 4 - (1'' H - 4'' - 氯吡啶 - 1'' - 基) - 4, 5 - 二氢 - 1 - 吡唑啉甲酰苯胺和 N - (4 - 三氟甲氧基) - 3 - (4' - 氯苯基) - 4 - (1'' H - 4'' - 氯吡啶 - 1'' - 基) - 4, 5 - 二氢 - 1 - 吡唑啉甲酰苯胺 (参考 EP - A - 0 438 690)。

但是，这些先有技术化合物并不是在所有应用领域的作用水平和作用持久性都完全令人满意，特别是抗某些有机体或以低浓度使用时更是如此。

已发现下式 (I) 的新的取代的吡唑啉衍生物：



其中

R^1 代表不饱和的五元的、任选取代或任选苯稠合的含 1 至 4 个氮原子的杂环；

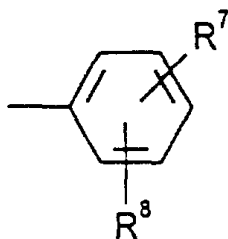
R^2 代表氢、烷基、任选取代的环烷基、卤代烷基、卤代烷硫基、烷氧羰基或三烷基甲硅烷基；

R^3 代表氢或烷基；

R^4 代表氢或烷基；

R^5 代表氰基或各自任选取代的烷基、环烷基、链烯基或炔基，或代表甲酰基，或各自任选取代的烷基羰基或烷氧羰基；

R^6 代表任选取代的烷基、任选取代的环烷基或下式基团：



其中 R^7 和 R^8 可相同或不相同，并代表氢、卤素、烷基、硝基、氰基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷硫基、卤代烷硫基、各自任选取代的苯氧基或苯硫基、任选取代的单或双烷基氨基、任选取代的环烷基、烷氧羰基、链烯基、炔基、烷基亚硫酰基、烷基磺酰基、卤代烷基亚硫酰基、卤代烷基磺酰基、卤代烷氧羰基，或

R^7 和 R^8 一起代表两价的含有一个或二个氧原子的任选取代的基团；

X 代表氧或硫；和

Y 和 Z 各自独立地代表氢、烷基、卤素、卤代烷基、烷氧基、烷

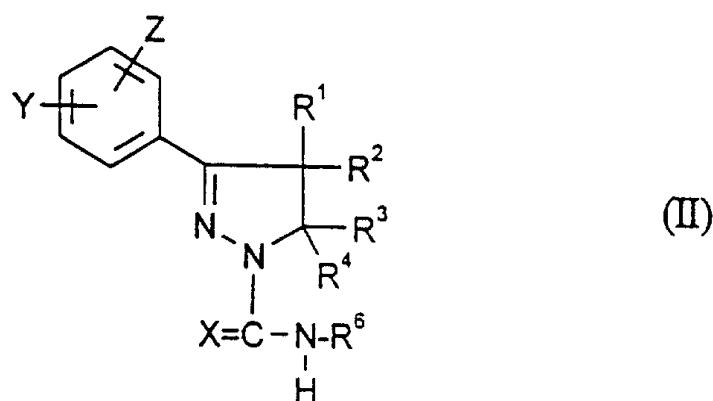
硫基、卤代烷氧基、卤代烷硫基、烷氧羰基、卤代烷氧羰基、各自任选取代芳氧基或芳硫基、链烯基、炔基、烷基亚硫酰基、烷基磺酰基、卤代烷基亚硫酰基、卤代烷基磺酰基、氨基、任选取代的单或双烷基氨基、硝基或氰基，或

Y 和 Z 一起代表都为卤素任选取代的 3,4-亚甲二氧基或 3,4-亚乙二氧基。

随着取代基性质的不同，式 (I) 化合物可以几何异构体和/或旋光异构体或不同组分的异构体混合物的形式存在。本发明涉及各种纯的异构体，也涉及异构体的混合物。

此外，还已经发现式 (I) 的新的取代的吡唑啉衍生物可由下述方法得到，包括

- a) 在碱存在下，并且适宜时在稀释剂存在下，使式 (II) 的取代的吡唑啉衍生物与式 (III) 化合物反应，



式 (II) 中，

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^6 、X、Y 和 Z 具有前述意义；

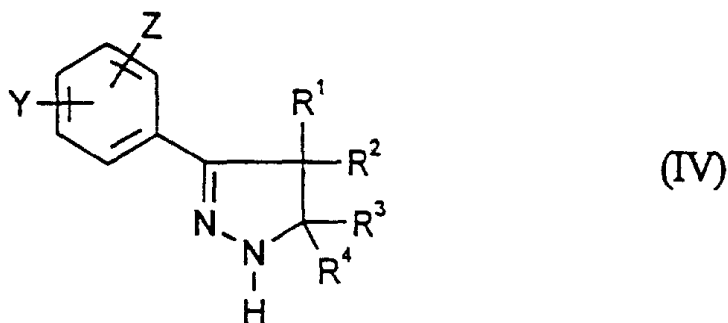
R^5 -A (III)

式 (III) 中,

R^5 具有前述意义, 且

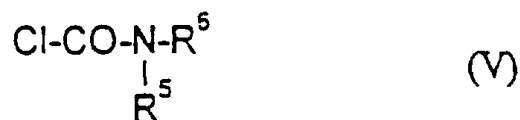
A 代表适宜的离去基团: 或

b) 适宜时在碱存在下, 且适宜时在稀释剂存在下, 使式 (IV) 的取代的吡唑啉衍生物与式 (V) 的化合物反应,



式 (IV) 中,

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、Y 和 Z 具有前述意义:



式 (V) 中,

R^5 和 R^6 具有前述意义。

最后, 还发现式 (I) 的新的取代的吡唑啉衍生物具有很好的抗害虫的活性, 具体地说, 具有很好的杀虫和杀螨活性。

令人惊奇的是, 本发明的取代的吡唑啉衍生物比先有技术中已知的, 且化学上及作用原理上都相似的化合物表现出明显更优的抗对植物有害和寄生在温血动物中的昆虫和蜘蛛纲动物的活性。

式 (I) 提供了本发明的取代的吡唑啉衍生物的一般定义。

在下文中，列出前述或后面提及的通式中列举的优选取代基或基团范围：

R¹ 优选代表 1H-吡咯-1-基、1H-吡唑-1-基、1H-咪唑-1-基、2H-1,2,3-三唑-2-基、1H-1,2,3-三唑-1-基、1H-1,2,4-三唑-1-基、4H-1,2,4-三唑-4-基、2H-四唑-2-基或1H-四唑-1-基，它们任选被选自下列基团的相同或不相同取代基单取代或多取代：卤素、烷基（C₁-C₆）、CN、NO₂、烷氧基（C₁-C₆）羰基、烷基（C₁-C₆）硫基、烷氧基（C₁-C₆）、卤代烷基（C₁-C₄）、卤代烷（C₁-C₄）硫基、卤代烷氧基（C₁-C₄）、氨基、单或双烷基（C₁-C₄）氨基或卤代烷氧基（C₁-C₆）羰基，

R² 优选代表氢、烷基（C₁-C₆）、任选被卤素或卤代烷基（C₁-C₄）取代的环烷基（C₃-C₇）；或优选代表卤代烷基（C₁-C₄）、卤代烷（C₁-C₄）硫基、烷氧基（C₁-C₆）羰基或三烷基（C₁-C₆）甲硅烷基，

R³ 优选代表氢或烷基（C₁-C₆）。

R⁴ 优选代表氢或烷基（C₁-C₆）。

R⁵ 优选代表氰基或任选被卤素、烷氧基（C₁-C₆）或下列基团之一取代的烷基（C₁-C₁₀）：



其中

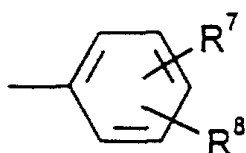
R^7 代表任选被卤素取代的烷基 ($C_1 - C_{10}$) ;

R^8 和 R^9 相同或不相同, 并代表烷基 ($C_1 - C_{10}$), 或

R^8 和 R^9 共同与和它们键合在一起的氮原子构成任选还再含一个杂原子的 3 至 8 元环,

或优选代表被卤素或卤代烷基 ($C_1 - C_6$) 任选取代的环烷基 ($C_3 - C_8$)、任选被卤素或烷氧基 ($C_1 - C_6$) 取代的链烯基 ($C_2 - C_8$) 或炔基 ($C_2 - C_8$) 或甲酰基、或任选被卤素取代的烷基 ($C_1 - C_{10}$) 羰基或任选被卤素取代的烷氧 ($C_1 - C_{10}$) 羰基,

R^6 优选代表任选被卤素或卤代烷氧基 ($C_1 - C_4$) 取代的烷基 ($C_1 - C_6$)、或优选代表任选被卤素、卤代烷基 ($C_1 - C_4$) 或卤代烷氧基 ($C_1 - C_4$) 取代的环烷基 ($C_3 - C_7$), 或下式基团

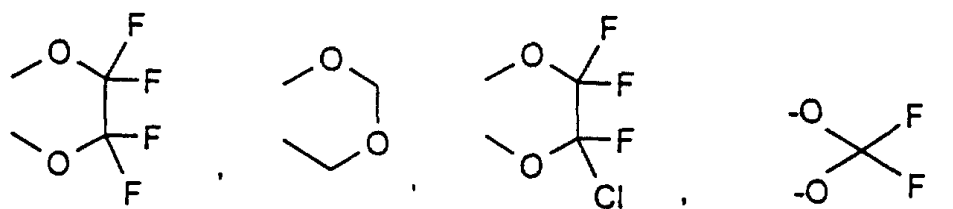


其中

R^7 和 R^8 相同或不相同, 并代表氢、卤素、烷基 ($C_1 - C_6$)、硝基、氰基、卤代烷基 ($C_1 - C_6$)、烷氧基 ($C_1 - C_6$)、卤代烷氧基 ($C_1 - C_6$)、烷 ($C_1 - C_6$) 硫基、卤代烷 ($C_1 - C_6$) 硫基、或各自任选被卤素、卤代烷基 ($C_1 - C_6$)、烷氧基 ($C_1 - C_6$) 或烷基 ($C_1 - C_6$) 取代的苯氧基或

苯硫基、任选被卤素或烷氧基 (C₁ - C₄) 取代且各自在烷基部分含 1 至 6 个碳原子的单或双烷基氨基、任选被烷基 (C₁ - C₄)、烷氧基 (C₁ - C₄)、卤素、或烷 (C₁ - C₄) 硫基取代的环烷基 (C₃ - C₇)、烷氧 (C₁ - C₆) 羰基、链烯基 (C₂ - C₆)、炔基 (C₂ - C₆)、烷 (C₁ - C₄) 亚硫酰基、烷 (C₁ - C₄) 磺酰基、卤代烷 (C₁ - C₄) 亚硫酰基、卤代烷 (C₁ - C₄) 磺酰基或卤代烷氧 (C₁ - C₄) 羰基或其中

R⁷ 和 R⁸ 一起代表下列二价基团中的一个：



X 优选代表氧或硫，

Y 和 Z 各自独立地优选代表氢、烷基 (C₁ - C₆)、卤素、卤代烷基 (C₁ - C₆)、烷氧基 (C₁ - C₆)、烷 (C₁ - C₆) 硫基、卤代烷氧基 (C₁ - C₆)、卤代烷 (C₁ - C₆) 硫基、烷氧 (C₁ - C₄) 羰基、卤代烷氧 (C₁ - C₄) 羰基、任选被卤素、烷基 (C₁ - C₄)、烷氧基 (C₁ - C₄) 或卤代烷基 (C₁ - C₄) 取代的苯氧基或苯硫基、链烯基 (C₂ - C₆)、炔基 (C₂ - C₆)、烷基 (C₁ - C₄) 亚硫酰基、烷基 (C₁ - C₄) 磺酰基、卤代烷基 (C₁ - C₄) 亚硫酰基、卤代烷基 (C₁ - C₄)

磺酰基、任选被卤素或烷氧基 ($C_1 - C_4$) 取代的单或双烷基 ($C_1 - C_6$) 氨基、硝基或氰基, 或

Y 和 Z 一起优选代表任选被氟和/或氯取代的 3,4-亚甲二氧基或 3,4-亚乙二氧基:

R¹ 特别优选代表 1H-吡咯-1-基、1H-吡唑-1-基、1H-咪唑-1-基、2H-1,2,3-三唑-2-基、1H-1,2,3-三唑-1-基、1H-1,2,4-三唑-1-基、4H-1,2,4-三唑-4-基、2H-四唑-2-基或 1H-四唑-1-基基团, 它们任选被选自下列基团的相同或不相同取代基单取代或双取代: 氟、氯、溴、碘、烷基 ($C_1 - C_4$)、CN、NO₂、烷氧 ($C_1 - C_4$) 羰基、烷 ($C_1 - C_3$) 硫基、烷氧基 ($C_1 - C_4$)、卤代烷基 ($C_1 - C_3$)、卤代烷 ($C_1 - C_3$) 硫基、氨基或双烷基 ($C_1 - C_3$) 氨基或卤代烷氧 ($C_1 - C_4$) 羰基,

R² 特别优选代表氢、烷基 ($C_1 - C_4$)、任选被氟、氯、溴或卤代烷基 ($C_1 - C_3$) 取代的环烷基 ($C_3 - C_6$)、卤代烷基 ($C_1 - C_3$)、卤代烷 ($C_1 - C_3$) 硫基、烷氧 ($C_1 - C_4$) 羰基或三烷基 ($C_1 - C_4$) 甲硅烷基,

R³ 特别优选代表氢或烷基 ($C_1 - C_4$),

R⁴ 特别优选代表氢或烷基 ($C_1 - C_4$),

R⁵ 特别优选代表氰基、任选被氟、氯、溴、烷氧基 ($C_1 - C_4$) 或下列基团之一取代的烷基 ($C_1 - C_6$):

CO₂R⁷ 或 NR⁸R⁹,

其中

R^7 代表任选被氟、氯和/或溴取代的烷基 ($C_1 - C_8$) ;

R^8 和 R^9 相同或不相同, 并代表烷基 ($C_1 - C_8$), 或

者共同与和它们相键合的氮原子一起构成任选含有一个

氧原子的 3 至 7 元环;

或特别优选代表被氟、氯、溴或卤代烷基 ($C_1 - C_4$) 取代的

环烷基 ($C_3 - C_6$)、任选被氟、氯、溴或烷氧基 (C_1

$- C_4$) 取代的链烯基 ($C_3 - C_7$) 或炔基 ($C_3 - C_7$)、

甲酰基、各自任选被氟、氯和/或溴取代的烷基 ($C_1 -$

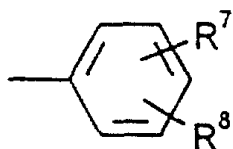
C_8) 羰基或烷氧 ($C_1 - C_8$) 羰基,

R^6 特别优选代表任选被氟、氯、溴或卤代烷氧基 ($C_1 - C_3$)

取代的烷基 ($C_1 - C_6$)、任选被氟、氯、溴、卤代烷基

($C_1 - C_3$) 或卤代烷氧基 ($C_1 - C_3$) 取代的环烷基

($C_3 - C_6$), 或下列基团



其中

R^7 和 R^8 相同或不相同, 并代表氢、氟、氯、溴、碘、烷

基 ($C_1 - C_4$)、硝基、氰基、卤代烷基 ($C_1 -$

C_3)、烷氧基 ($C_1 - C_4$)、卤代烷氧基 ($C_1 -$

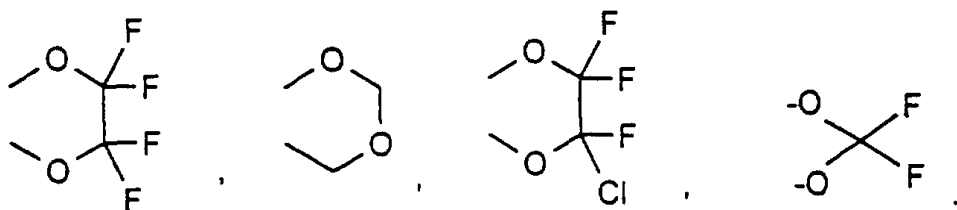
C_3)、烷 ($C_1 - C_3$) 硫基、卤代烷 ($C_1 - C_3$)

硫基、任选被氟、氯、溴、卤代烷基 ($C_1 - C_3$)、

烷氧基 ($C_1 - C_3$) 或烷基 ($C_1 - C_3$) 取代的苯

氧基、任选被氟、氯、溴或烷氧基 (C₁ - C₃) 取代且各自在烷基部分含 1 至 4 个碳原子的单或双烷基氨基、任选被烷基 (C₁ - C₃)、烷氧基 (C₁ - C₃)、氟、氯、溴或烷 (C₁ - C₃) 硫基取代的环烷基 (C₃ - C₆)、或其中

R⁷ 和 R⁸ 一起代表下列二价基团：



X 特别优选代表氧或硫，

Y 和 Z 各自独立地特别优选代表氢、烷基 (C₁ - C₄)、氟、氯、溴、碘、卤代烷基 (C₁ - C₄)、烷氧基 (C₁ - C₄)、烷 (C₁ - C₄) 硫基、卤代烷氧基 (C₁ - C₃)、卤代烷基 (C₁ - C₃) 硫基、烷氧 (C₁ - C₃) 羰基、任选被氟、氯、溴、烷基 (C₁ - C₃)、烷氧基 (C₁ - C₃) 或卤代烷基 (C₁ - C₃) 取代的苯氧基或苯硫基、卤代烷氧 (C₁ - C₃) 羰基、链烯基 (C₂ - C₄)、炔基 (C₂ - C₄)、烷基 (C₁ - C₃) 亚硫酰基、烷基 (C₁ - C₃) 磺酰基、卤代烷基 (C₁ - C₃) 磺酰基、任选被卤素或烷氧基 (C₁ - C₃) 取代的单或双烷基 (C₁ - C₃) 氨基、硝基或氰基，或

Y 和 Z 一起特别优选代表任选被氟和/或氯取代的 3,4-亚甲二氧基或 3,4-亚乙二氧基。

- R¹ 尤其特别优选代表 1H-吡咯-1-基、1H-吡唑-1-基、1H-咪唑-1-基、2H-1,2,3-三唑-2-基、1H-1,2,3-三唑-1-基、1H-1,2,4-三唑-1-基、4H-1,2,4-三唑-4-基、2H-四唑-2-基或 1H-四唑-1-基, 任选被选自下列基团的相同或不相同取代基单取代或二取代: 氟、溴、碘、烷基(C₁-C₃)、CN、NO₂、烷氧(C₁-C₃)羰基、烷(C₁-C₂)硫基、烷氧基(C₁-C₃)、卤代烷基(C₁-C₃)、卤代烷(C₁-C₂)硫基、双烷基(C₁-C₂)氨基或卤代烷氧(C₁-C₃)羰基;
- R² 尤其特别优选代表氢、烷基(C₁-C₃)、卤代烷基(C₁-C₂)、烷氧(C₁-C₃)羰基或三烷基(C₁-C₃)甲硅烷基;
- R³ 尤其特别优选代表氢、甲基、乙基或丙基;
- R⁴ 尤其特别优选代表氢、甲基、乙基或丙基;
- R⁵ 尤其特别优选代表氰基、任选被下列取代基取代的烷基(C₁-C₆): 氟、氯、烷氧基(C₁-C₃)或下列基团之一:

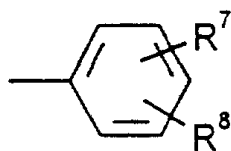


其中

- R⁷ 代表任选被氟和 或 氯取代的烷基(C₁-C₆);
- R⁸ 和 R⁹ 相同或不相同, 并代表烷基(C₁-C₆), 或和与它们键合的氮原子一起形成任选含 1 个氧原子的 5 或 6 元环;

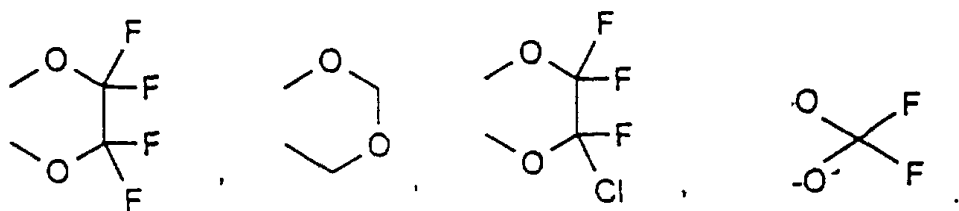
或尤其特别优选代表任选被氟、氯或卤代烷基 (C₁ - C₃) 取代的含 3、5 或 6 个碳原子的环烷基、任选被氟、氯或烷氧基 (C₁ - C₃) 取代的链烯基 (C₃ - C₆) 或炔基 (C₃ - C₆)、甲酰基、任选被氟和/或氯取代的烷基 (C₁ - C₆) 羰基或烷氧基 (C₁ - C₆) 羰基；

R⁶ 尤其特别优选代表任选被氟、氯、卤代烷基 (C₁ - C₃) 或卤代烷氧基 (C₁ - C₂) 取代的环烷基 (C₃ - C₆)，或下列基团：



其中

R⁷ 和 R⁸ 相同或不相同，并代表氢、氟、氯、溴、烷基 (C₁ - C₃)、硝基、氰基、卤代烷基 (C₁ - C₃)、烷氧基 (C₁ - C₃)、卤代烷氧基 (C₁ - C₂)、烷 (C₁ - C₂) 硫基或卤代烷 (C₁ - C₂) 硫基、任选被氟、氯、溴、卤代烷基 (C₁ - C₂)、烷氧基 (C₁ - C₂) 或烷基 (C₁ - C₂) 取代的苯氧基、任选被氟、氯或烷氧基 (C₁ - C₃) 取代且各自在烷基部分含 1 至 3 个碳原子的单或双烷基氨基、任选被烷基 (C₁ - C₂)、烷氧基 (C₁ - C₂)、氟、氯或烷 (C₁ - C₂) 硫基取代含 3、5 或 6 个碳原子的环烷基，或 R⁷ 和 R⁸ 一起代表下列二价基团中的一个：



X 尤其特别优选代表氧或硫：

Y 和 Z 各自独立地尤其特别优选代表氢、烷基 ($C_1 - C_3$)、氟、氯、溴、卤代烷基 ($C_1 - C_3$)、烷氧基 ($C_1 - C_3$)、烷 ($C_1 - C_3$) 硫基、卤代烷氧基 ($C_1 - C_2$)、卤代烷 ($C_1 - C_2$) 硫基、烷氧 ($C_1 - C_2$) 羰基、任选被氟、氯、溴、烷基 ($C_1 - C_3$)、烷氧基 ($C_1 - C_3$) 或卤代烷基 ($C_1 - C_3$) 取代的苯氧基、卤代烷氧 ($C_1 - C_2$) 羰基、链烯基 ($C_2 - C_4$)、烷基 ($C_1 - C_3$) 亚硫酰基、烷基 ($C_1 - C_3$) 磺酰基、卤代烷基 ($C_1 - C_3$) 磺酰基、任选被氟、氯或烷氧基 ($C_1 - C_2$) 取代的单或双烷基 ($C_1 - C_3$) 氨基、硝基、氰基；或

Y 和 Z 一起尤其特别优选代表任选被氟和 / 或氯取代的 3, 4 - 亚甲二氧基或 3, 4 - 亚乙二氧基。

在基团卤代烷基、卤代烷氧基、卤代烷硫基、卤代烷基亚硫酰基和卤代烷基磺酰基中的卤代烷基的意义优选必需有 1 至 9 个，特别优选 1 至 7 个、并且尤其特别优选 1 至 5 个相同或不不同的选自氟、氯、溴、优选选自氟和 / 或氯的卤素原子：

只要可能，上述烃基和与杂原子相连的烃基，如在烷氧基或烷基磺酰基中的烃基，在各种情况下可为直链或支链。

上述给出的基团的一般定义或说明，或其优选的范围可根据需要

而互相组合，即可在特定的范围和优选的范围间进行组合。它们适用于最终产物，并类似地适用于前体和中间物。

本发明优选的通式 (I) 的化合物为其中有上述 优选的基团意义组合的那些化合物。

本发明 特别优选的通式 (I) 的化合物为其中有上述 特别优选的基团意义组合的那些化合物。

本发明尤其特别优选的通式 (I) 的化合物为其中有上述尤其特别优选的基团意义组合的那些化合物。

除在制备实施例中提及的化合物之外，还可逐一列出下列通式 (I) 的取代的吡唑啉衍生物：

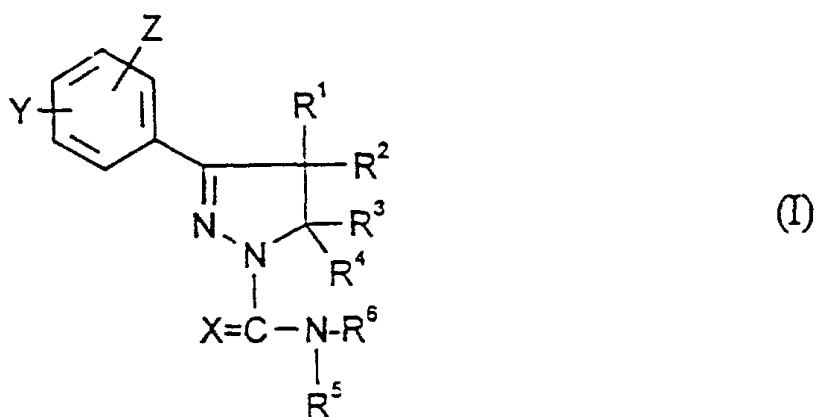


表 1

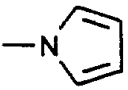
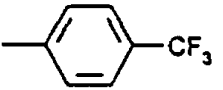
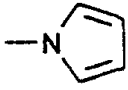
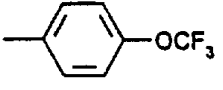
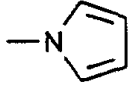
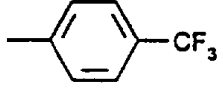
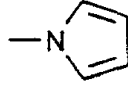
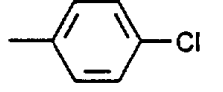
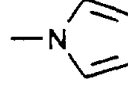
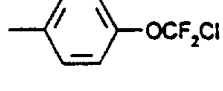
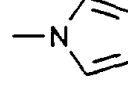
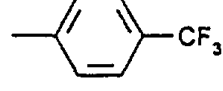
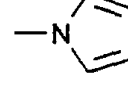
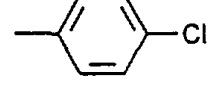
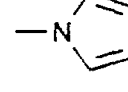
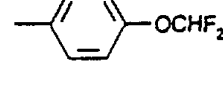
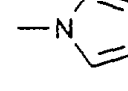
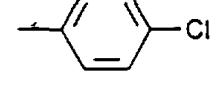
Y	Z	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
H	H	O		H	H	H	CH ₃	
H	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-CF ₃	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-CF ₃	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-CF ₃	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Br	H	O		H	H	H	CH ₃	
3-CF ₃	H	O		H	H	H	CH ₃	
3-CF ₃	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	

表 1 (续)

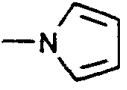
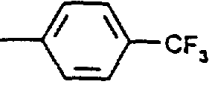
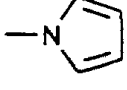
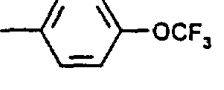
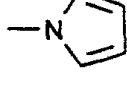
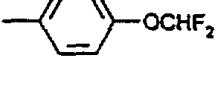
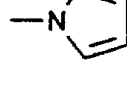
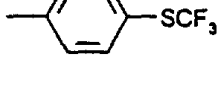
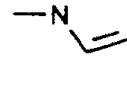
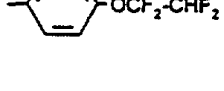
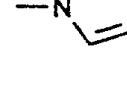
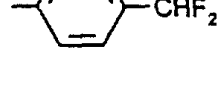

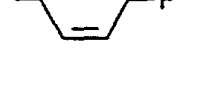




Y	Z	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-OCHF ₂	H	O		H	H	H	CH ₃	

表 1 (续)

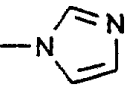
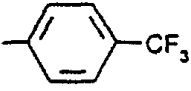
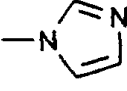

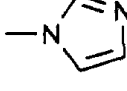
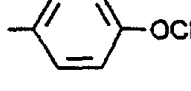
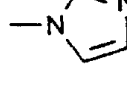
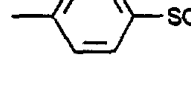
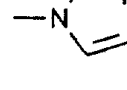
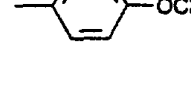
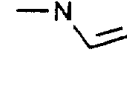

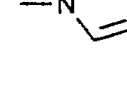

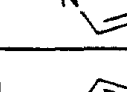

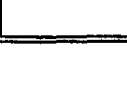
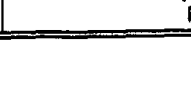
Y	Z	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	

表 1 (续)

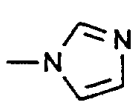
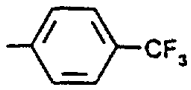
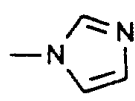
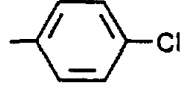
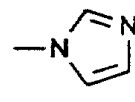
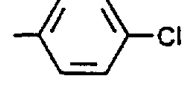
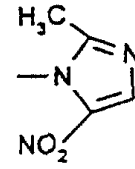
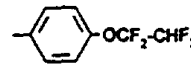
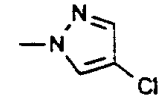
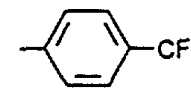
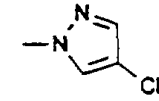
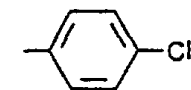
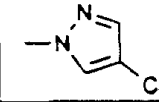
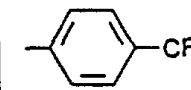
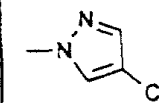
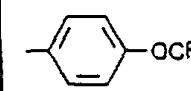
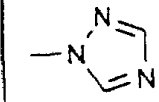
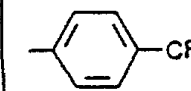
Y	Z	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
4-OCHF ₂	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-OCHF ₂	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-OCHF ₂ CF ₃	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-OCHF ₂ CF ₃	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-CF ₃	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-CF ₃	H	O		H	H	H	CH ₃	
H	H	O		H	H	H	CH ₃	

表 1 (续)

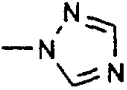
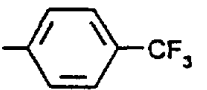
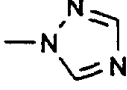
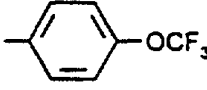
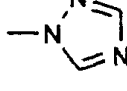
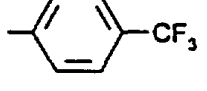
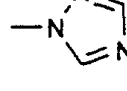
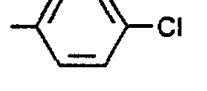
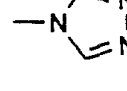
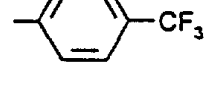
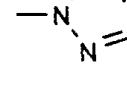
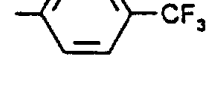
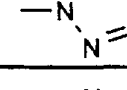
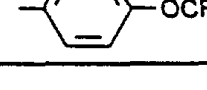
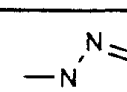
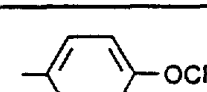
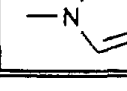
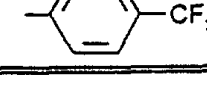


Y	Z	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
4-叔丁基	H	O		H	H	H	CH ₃	
3-CF ₃	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-CH ₃	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-CH ₃	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	CH ₃	H	CH ₃	
4-OCHF ₂	H	O		H	CH ₃	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	

表 1 (续)

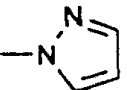
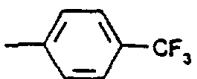
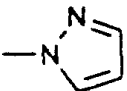
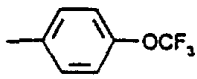
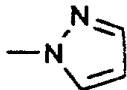

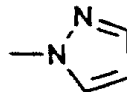
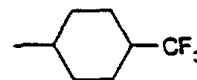
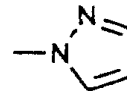
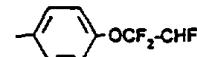
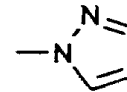
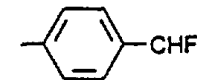
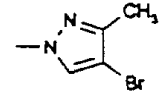
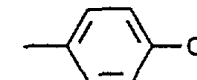
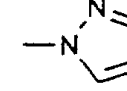

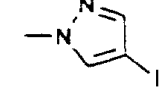
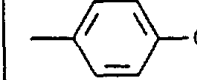
Y	Z	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Br	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-H	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	3-Cl	O		CH ₃	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	

表 1 (续)

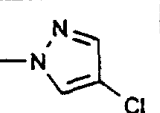
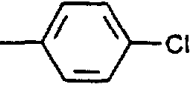
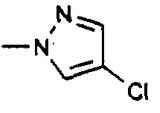
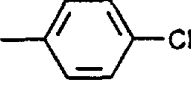
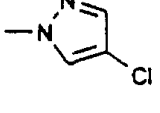
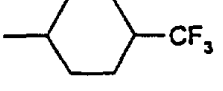
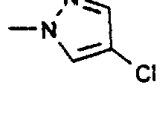
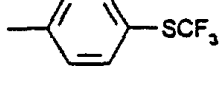
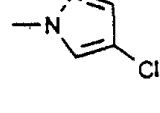
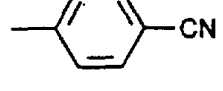
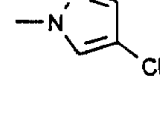
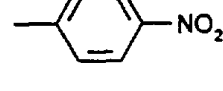
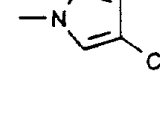
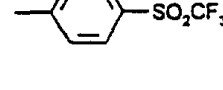
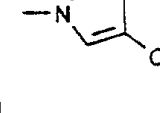

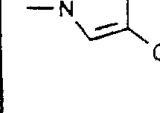
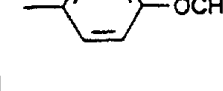
Y	Z	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-H	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	

表 1 (续)

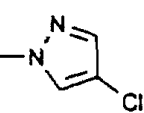
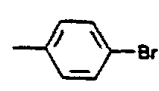
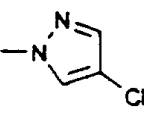
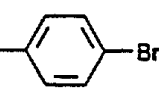
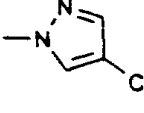
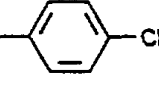
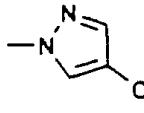
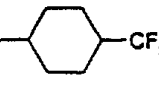
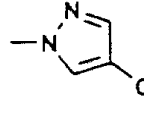
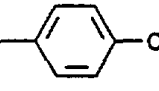
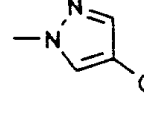
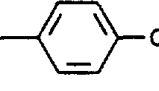
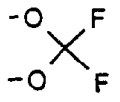
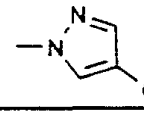
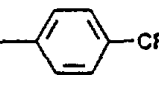
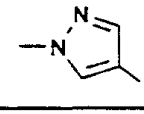
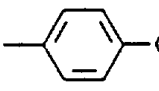
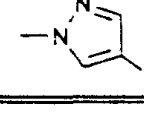
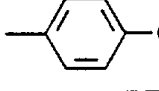
Y	Z	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-OCH ₃	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Br	H	O		H	H	H	CH ₃	
3,4- 		O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	CH ₃	CH ₃	
4-Cl	H	O		iso-Prop	H	H	CH ₃	

表 1 (续)

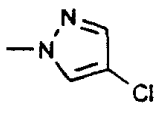
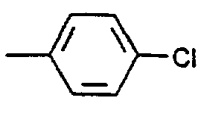
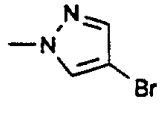
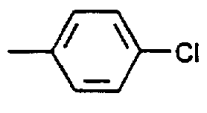
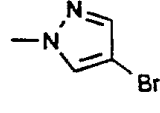
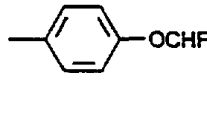
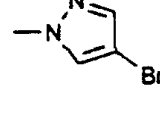
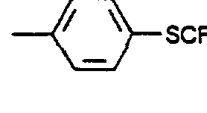
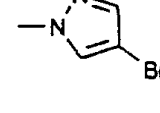
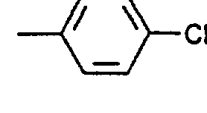
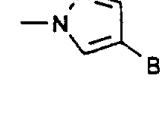
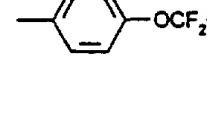
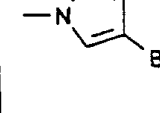
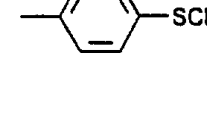
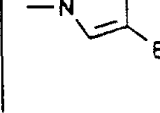
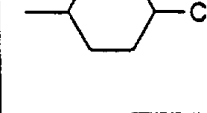
Y	Z	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
4-Cl	H	S		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	

表 1 (续)

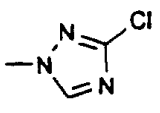
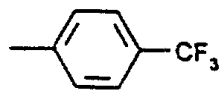
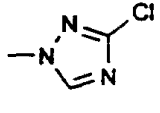
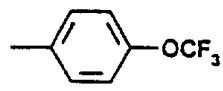
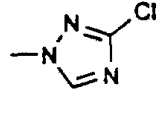
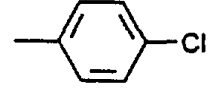
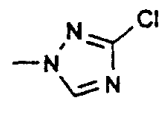
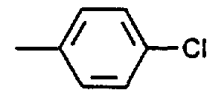
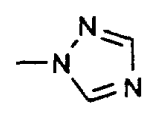
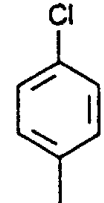
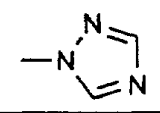
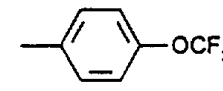
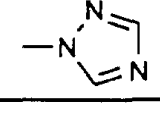

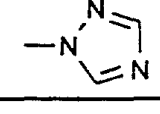

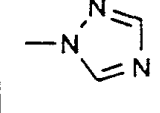
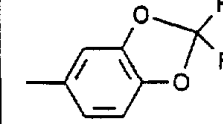
Y	Z	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	S		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Br	H	S		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	

表 1 (续)

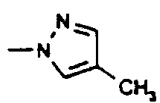
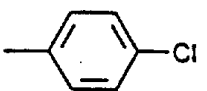
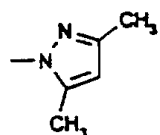
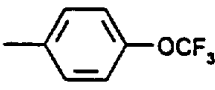
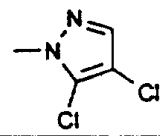
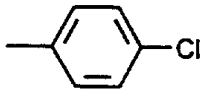
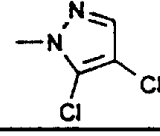
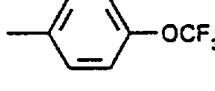
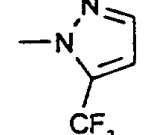
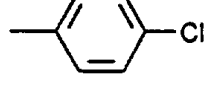
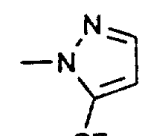
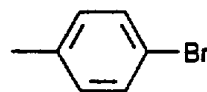
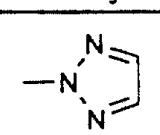

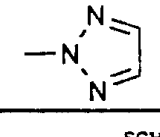
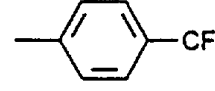
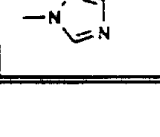
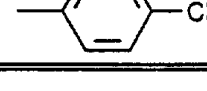
Y	Z	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-F	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	
4-Cl	H	O		H	H	H	CH ₃	

表 2

在表 2 中, Y、Z、X、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^6 意义如表 1 所列, 但 R^5 在各种情况下均代表 C_2H_5 。

表 3

在表 3 中, Y、Z、X、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^6 意义如表 1 所列, 但 R^5 在各种情况下均代表正丙基。

表 4

在表 4 中, Y、Z、X、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^6 意义如表 1 所列, 但 R^5 在各种情况下均代表异丙基。

表 5

在表 5 中, Y、Z、X、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^6 意义如表 1 所列, 但 R^5 在各种情况下均代表正丁基。

表 6

在表 6 中, Y、Z、X、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^6 意义如表 1 所列, 但 R^5 在各种情况下均代表 CO_2CH_3 。

表 7

在表 7 中, Y、Z、X、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^6 意义如表 1 所列, 但 R^5 在各种情况下均代表 $CO_2C_2H_5$ 。

表 8

在表 8 中, Y、Z、X、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^6 意义如表 1 所列, 但 R^5 在各种情况下均代表 $CH_2=CH$ 。

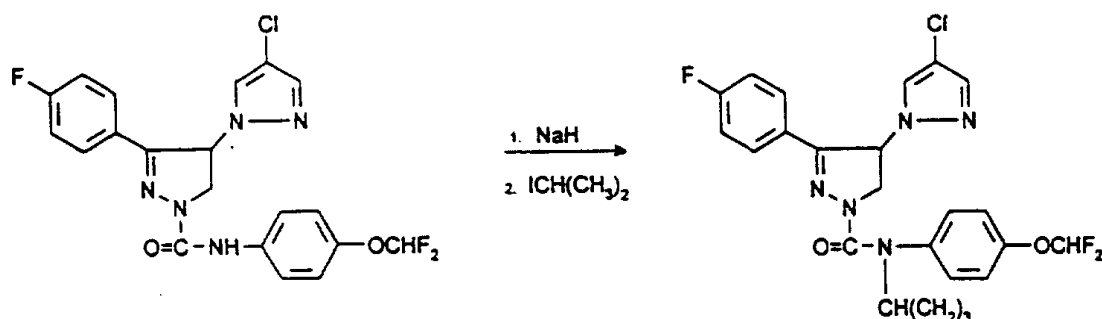
表 9

在表 9 中, Y、Z、X、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^6 意义如表 1 所列, 但 R^5 在各种情况下均代表 $CH_2CO_2CH_3$ 。

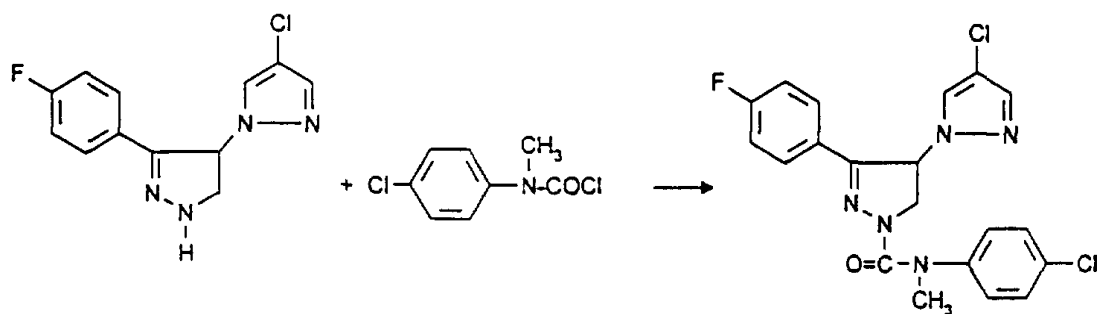
表 1 0

在表 1 0 中, Y、Z、X、R¹、R²、R³、R⁴ 和 R⁶ 意义如表 1 所列, 但 R⁵ 在各种情况下均代表 CH₂ CH₂ OCH₃。

例如, 如果以 N - (4 - 二氟甲氧基) - 3 - (4' - 氟苯基) - 4 - (1'' H - 4'' - 氯吡唑 - 1'' - 基) - 4, 5 - 二氢 - 1 - 吡唑甲酰苯胺和 2 - 碘代丙烷作为起始物, 以氢化钠为碱, 则本发明的方法 (a) 的反应过程可用下述反应式表示:



例如, 如果以 3 - (4' - 氟苯基) - 4 - (1'' H - 4'' - 氯吡唑 - 1'' - 基) - 4, 5 - 二氢吡唑和 N - 甲基 - 4 - 氯苯基氨基甲酰氯作为起始物, 则本发明的方法 (b) 的反应过程可用下述反应式表示:



式 (II) 提供了用于实施本发明的方法所需的起始原料取代的吡唑啉衍生物的一般定义。在式 (II) 中, R¹、R²、R³、R⁴

R⁶、Y和Z优选，或特别优选代表的基团为在本发明的式(I)化合物的描述中已提及的优选，或特别优选的那些基团。式(II)的取代的吡啶衍生物为已知和/或可以用已知的方法(参见EP - A - 0 438 690)得到。

式(III)提供了用于实施本发明方法(a)所需的起始原料烷基化剂或酰基化剂的一般定义。在式(III)中，R⁵优选代表，或特别优选代表的基团为在本发明的式(I)化合物的描述中已提及的优选或特别优选的那些基团。

A代表离去基团，优选为卤素，特别是氯、溴或碘，或各自任选取代的烷基磺酰氧基，烷氧基磺酰氧基或芳磺酰氧基，例如特别是甲磺酰氧基、三氟甲磺酰氧基、甲氧基磺酰氧基、乙氧基磺酰氧基或对甲苯磺酰氧基。

式(III)的化合物为有机化学中已知的合成化学物质。

式(IV)提供了用于实施本发明方法(b)所需的起始物取代的吡啶类的一般定义。在式(IV)中，R¹、R²、R³、R⁴、Y和Z优选或特别优选代表的基团为在描述本发明式(I)化合物时已提及的那些优选或特别优选的取代基。式(IV)的取代的吡啶类为已知和/或可用已知方法得到(参考EP - A - 0 438 690和EP - A - 0 546 420)。

式(V)提供了用于实施本发明方法(b)所需的起始物氨基甲酰氯的一般定义。在式(V)中，R⁵和R⁶优选代表或特别优选代表的基团为在描述本发明式(I)化合物时已提及的那些优选或特别优选的那些取代基。式(V)的氨基甲酰氯为有机化学中已知的化合物。它们例如通过使相应的取代的胺类与光气反应而得到。

方法 (a) 包括在碱存在下, 且适宜时在稀释剂存在下, 使其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、X、Y 和 Z 具有前述意义的式 (II) 化合物与其中 R^5 和 A 具有前述意义的式 (III) 化合物反应。

实施本发明的方法 (a) 时, 可采用的碱类为所有常见的质子接受剂。可优选采用: 碱金属氧化物、碱金属氢氧化物、碱金属碳酸盐、碱土金属氧化物、碱土金属氢氧化物和碱土金属碳酸盐, 如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙, 它们也都可以例如下述相转移催化剂存在下使用: 三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化铵、Adogen 464 (甲基三烷基 ($C_8 - C_{10}$) 氯化铵) 或 TDA 1 (三 (甲氧基乙氧基乙基) 胺)。

另外, 也可采用碱金属例如钠或钾, 还有碱金属氨基化物、碱金属氢化物、碱土金属氨基化物和碱土金属氢化物, 例如氨基化钠、氢化钠和氢化钙, 并且还可使用碱金属醇盐, 如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

可在本发明方法 (a) 中采用的稀释剂为所有惰性溶剂。可优选使用烃类, 如汽油、苯、甲苯、二甲苯和 1, 2, 3, 4 - 四氢化萘; 以及卤代烃类, 如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、氯化苯和邻 - 二氯苯; 还有酮类, 如丙酮和甲基异丙基酮; 醚类, 如乙醚、四氢呋喃和二噁烷; 羧酸酯类, 如乙酸乙酯; 强极性溶剂, 如二甲基亚砷和环丁砷。

在实施本发明方法 (a) 时, 反应温度可在相当宽的范围变化。一般而言, 此方法在 $-20 \sim 150^\circ\text{C}$ 温度下, 优选在 $0 \sim 100^\circ\text{C}$ 温度下进行。

式 (II) 的起始物和式 (III) 起始物一般采用等摩尔量, 但也可采用过量的式 (III) 化合物。

在实施本发明方法 (a) 时, 碱一般至少以等摩尔量加入。

此方法优选在大气压下实施。

方法 (b) 包括适宜时在碱存在下, 且适宜时在稀释剂存在下, 使其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、Y 和 Z 具有前述意义的式 (IV) 化合物与其中 R^5 和 R^6 具有前述意义的式 (V) 的氨基甲酰氯反应。

实施本发明方法 (b) 时, 适用的碱为所有常见的有机碱和无机碱, 可列举的例子有: 氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、三乙基胺或吡啶。

适用的稀释剂为所有惰性极性有机溶剂, 为烃类、醚类、酰胺类、砜类和亚砜类, 优选使用甲苯、二甲基亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺或二氯甲烷。

使约 1 摩尔式 (V) 的氨基甲酰氯在 $0 - 150^{\circ}\text{C}$ 、优选 $20 - 70^{\circ}\text{C}$ 下与每 1 摩尔式 (IV) 的起始化合物反应。

本方法优选在大气压下实施。

本发明的活性化合物适用于防治动物害虫, 优选节肢动物和线虫, 特别是农业、动物饲养、林业以及储存产品和材料的保护以及卫生部门中出现的昆虫和蜘蛛纲动物。它们对于通常敏感和有抗性的物种及其全部或部分发育阶段均具有活性。上述害虫包括:

等足目, 例如潮虫、平甲虫和鼠妇。

倍足目, 例如具斑马陆。

唇足目, 例如食果地蜈蚣和蛭螋属。

扁肩象目, 例如庭院么虫。

缨尾目, 例如西洋衣鱼。

弹尾目, 例如具刺跳虫。

直翅目, 例如东方蜚蠊、美洲大蠊、马拉蜚蠊、德国蠊、家蟋蟀、

蝼蛄属、热带飞蝗、殊种蚱蜢和沙漠蝗。

革翅目，例如欧洲球螋。

等翅目，例如犀白蚁属。

虱目，例如体虱、血虱属和长颚虱属。

食毛目，例如嚼虱属和畜虱属。

缨翅目，例如温室条蓟马和葱蓟马。

异翅亚目，例如扁盾蝽属、红蝽属、方背皮蝽属、温带臭虫、长红蝽蝽和蝽蝽属。

半翅目，例如甘蓝粉虱、木薯粉虱 (*Phylloxera vastatrix*、*Pemphigus* spp、温室粉虱、棉蚜、甘蓝蚜、茶蔗穗瘤蚜、*Aphis fabae*、*Doralis Pomi*、苹果绵蚜、桃大尾蚜、稠李溢管蚜、微叶蝉属、双叶叶蝉、黑尾时蝉、麦长管蚜、瘤蚜属、忽布疣蚜、李蜡蚧、油橄榄黑盔蚧、灰飞虱、稻褐飞虱、红圆蚧、夹竹桃圆蚧、粉蚧属和木虱属。

鳞刺目，例如棉红铃虫、松天蛾、冬天蛾、苹细蛾、苹果巢蛾、小菜蛾、黄褐天幕毛虫、黄毒蛾、毒蛾属、棉潜蛾、桔叶潜蛾、地虎属、刀根虫属、夜蛾属、棉斑实蛾、实夜蛾属、甜菜夜蛾、甘蓝夜蛾、小眼夜蛾、斜纹夜蛾、粘虫属、粉纹夜蛾、苹蠢蛾、粉蝶属、螟属、玉米螟、地中海粉螟、大蜡螟、负袋衣蛾、织网衣蛾、褐织衣蛾、亚麻黄卷蛾、具网卷叶蛾、云松卷蛾、葡萄果蠢蛾、茶长卷蛾和栎绿卷叶蛾。

鞘翅目，例如具斑窃蠹、谷蠹、豆象、家天牛、赤杨紫跳甲、马铃薯甲虫、辣根猿叶虫、叶甲属、油菜蓝跳甲、墨西哥豆瓢虫、隐金甲属、锯谷盗、花象甲属、谷象属、葡萄黑象甲、香蕉根象

甲、甘蓝荚象甲、苜蓿叶象甲、皮蠹属、斑皮蠹属、圆皮蠹属、毛皮蠹属、粉蠹属、油菜花露尾甲、蛛甲属、金黄蛛甲、麦蛛甲、拟谷盗属、大黄粉虫、叩甲属、金针虫属、西方五月鳃角金龟、六月金龟和褐新西兰肋翅鳃角金龟。

膜刺目，例如锯角叶蜂属、叶蜂属、蚊尾属、厕蚊和胡蜂属。

双翅目，如伊蚊属、按蚊属、库蚊属、黄猩猩果蝇、家蝇属、(Hydrotaea spp., Haematobia spp., Glossina spp., Melophagus) 厕蝇属、红头丽蝇、绿蝇属、金蝇属、疽蝇属、胃蝇属、虱蝇属、厩螯蝇属、狂蝇属、皮蝇属、虻属、虻蚋属、花圆毛蚊、瑞典麦杆蝇、麦花蝇属、菠菜潜叶花蝇、地中海实蝇，油榄实蝇和欧洲大蚊。

蚤目，如印度客蚤和毛列蚤属。

蛛形纲，如蝎和盗蛛。

蜱螨目，如粗脚粉螨、锐缘蜱属、钝缘蜱属、鸡皮刺螨、茶蔗瘿螨、禽刺螨属、桔芸锈螨、牛蜱属、扁头蜱属、花蜱属、璃眼蜱属、硬蜱属、痒螨属、革蜱属、血蜱属、残喙蜱属、皮痒螨属、疥螨属、附线螨属、苜蓿苔螨、全爪螨属和叶螨属。

本发明的活性化合物不仅对植物害虫、卫生领域害虫和储藏产品害虫具有活性，而且在兽医领域，对防治动物寄生虫（外寄生虫和内寄生虫）也有活性，例如scaly ticks、隐缘蜱科、疥螨科、蜱螨、Trombididae：蝇（叮咬和吸食性）、寄生性蝇幼虫、虱目、发虱、羽虱、蚤目和内寄生蠕虫。

它们对通常敏感和有抗性的种类及种属以及对外寄生虫和内寄生虫的所有寄生和外寄生发育阶段都有活性。

本发明的活性化合物表现出极强的杀虫和杀螨作用。

它们可有效地用于清除对植物有害的昆虫，例如辣根猿叶甲（*Phaedon Cochlearia*）幼虫以及黑尾叶蝉（*Nephotettix Cincticeps*）幼虫。

此外，本发明的化合物还对寄生的原生动物门，特别是对球虫类和疟原虫有活性。

活性化合物可调制成常规的制剂，如溶液剂、乳液剂、悬浮液剂、粉末剂、泡沫体、糊剂、颗粒剂、气溶胶、浸泡了活性化合物的天然和合成材料，用于种子的在聚合物物质和包衣组合物中的微胶囊剂，以及与燃烧设备（如熏蒸筒、熏蒸罐、熏蒸盘管等）一起使用的制剂、以及超低容量（ULV）的冷雾和热雾制剂。

这些制剂用已知方法制成，例如可通过下述方法：任选使用表面活性剂（即乳化剂和/或分散剂和/或起泡剂）将活性化合物和稀释剂（即液体溶剂、带压下的液化气体和/或固体载体）混合。

如果采用水作稀释剂，则也可用（例如）有机溶剂作助溶剂。适用的液体溶剂主要有：芳族化合物（如二甲苯、甲苯或烷基萘）、氯化芳族化合物或氯代脂族烃类（如氯苯、二氯乙烷、二氯甲烷）、脂族烃类（如环己烷或石蜡如矿物油馏分）、醇类（如丁醇或二甘醇以及它们的醚类和酯类）、酮类（如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮）、强极性溶剂（如二甲基甲酰胺和二甲基亚砷以及水）；所谓液化的气体稀释剂或载体指在环境温度和大气压下为气态的液体（如气溶胶抛射剂，例如卤代烃和丁烷、丙烷和二氧化碳、氮）；适用的固体载体有：如研碎的天然矿物（例如高岭土、粘土、滑石粉、白垩、石英、绿坡缕石、蒙脱土或硅藻土）和研碎的合成矿物（如高

分散度氧化硅、氧化铝和硅酸盐)；适用的固体颗粒载体有：如粉碎并分级的天然岩石(例如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石)及合成的无机颗粒和有机粉，和有机材料颗粒(如锯末、椰壳、玉米棒碎块和烟叶杆)；适用的乳化剂和/或起泡剂有：如非离子型和阴离子型乳化剂(如聚乙二醇脂肪酸酯类、聚乙二醇烷基醇醚、烷基聚乙二醇醚、烷基磺酸盐、烷基硫酸酯、芳基磺酸盐以及蛋清水解产物)；适用的分散剂有：如亚硫酸纸浆废液、甲基纤维素；粘合剂有羧甲基纤维素和粉状、颗粒状或胶乳状天然和合成高聚物，如阿拉伯胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯以及天然磷脂，如脑磷脂和卵磷脂以及合成磷脂。其他添加剂可为矿物油和植物油。

可使用着色剂，如无机颜料(例如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝)和有机染料(如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料)以及微量的营养素(如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐)。

制剂中一般含有0.1至95%(重量)，优选0.5至90%(重量)的活性化合物。

本发明的活性化合物可存在于其市售制剂中和存在于由这些制剂制得的各种使用形式中，如和其它活性化合物(如杀虫剂、引诱剂、消毒剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、生长调节剂和除草剂)的混合物。这些杀虫剂包括，例如，磷酸酯、氨基甲酸酯、羧酸酯、氯代烃类、苯脲和微生物等产出的物质。

可列举下列化合物：

acrinathrin、alphamethrin、betacyfluthrin、bifenthrin、brofenprox、Cis - resmethrin、clopythrin、cycloprothrin、cyfluthrin、cyhalothrin、二氯苯醚菊脂、deltamethrin、

esfenvalerate、etofenprox、分扑菊酯、杀灭菊酯、flucythrinate、fluvalinate、lambda - cyhalothrin、二氯苯醚菊脂、pyresmethrin、除虫菊、Silaflofen、tralomethrin、zetamethrin、alanycarb、苯噁威、benfuracarb、混戊威、丁叉威、西维因、巴丹、乙硫甲威、fenlbucarb、fenoxycarb、异丙威、甲硫威、乙肼威、metolcarb、草肼威、灭定威、甲丙威、残杀威、叔丁威、thiodicarb、特氨叉威、trimethacarb、二甲威、xylylcarb、乙酰甲胺磷、谷硫磷 - A、谷硫磷 - M、溴硫磷 - A、Cadusafos、三硫磷、毒虫畏、氯甲硫磷、毒死蜱、Chlorpyrifos M、杀螟腈、甲基内吸磷、异吸磷 - II、异 - 一〇五九 - II、地亚农、敌敌畏、dicliphos、氯线磷、百治磷、乐果、dimethyovinphos、二噁硫磷、乙拌磷、克瘟散、乙硫磷、乙嘧硫磷、杀螟松、倍硫磷、地虫硫磷、安果、庚虫磷、iprobenfos、异丙三唑硫磷、异噁唑硫磷、马拉硫磷、灭蚜硫磷、mervinphos、mesulfenphos、丁烯硫磷、甲胺磷、三溴磷、氧化乐果、砒吸硫磷、oxydeprofos、对硫磷 - A、对硫磷 - M、稻丰散、甲拌磷、伏杀硫磷、亚胺硫磷、磷胺、肼硫磷、嘧啶硫磷 - A、嘧啶硫磷 - M、丙虫磷、低毒硫磷、发果、Pyraclophos、打杀磷、啮硫磷、杀抗松、Sebufos、硫特普、乙丙硫磷、杀虫畏、双硫磷、二甲硫吸磷、噻线磷、敌百虫、三唑硫磷、完灭硫磷；buprofezin、chlorfluazuron、伏虫脲、flucycloxuron、flufenoxuron、hexaflumuron、pyriproxifen、tebufenozide、teflubenzuron、triflumuron、imidacloprid、nitenpyram、N - [(6 - 氯 - 3 - 吡啶基) - 甲基] - N' - 氨基 - N - 甲基乙酰亚胺 - 酰胺 (-N I - 2 5)、abamectin、amitrazin、avermectin、azadirachtin、bensultap、

杀虫素、Cyromazine、diafenthiuron、emamectin、ethofenprox、fenpyrad、fipronil、flufenprox、lrfenuron、蜗牛敌、mibemectin、Pymetrozine、tebufenpyrad、triazuron、涕灭威、苯噁威、benfuracarb、呋喃丹、carbosulfan、chlorethoxyfos、cloethocarb、乙拌磷、丙线磷、乙嘧硫磷、克线磷、fipronil、地虫硫磷、fosthiazate、furathiocarb、六六六、异丙三唑硫磷、异丙胺磷、甲硫威、久效磷、Nitenpyram、草肟威、甲拌磷、肟硫磷、低毒硫磷、pyrachlofos、sebufos、silafulfen、tebupirimphos、tefluthrin、特丁磷、thiodicarb、特氮又威、唑环锡、butylpyridaben、clofentezine、三环锡、difenthiuron、乙硫磷、emamectin、fenazaquin、螞完锡、fenoithiocarb、分扑菊酯、fenpyrad、fenpyroximate、fluazinam、fluazuron、flucycloxuron、flufenoxuron、fluvalinate、fubfenprox、hexythiazox、ivemectin、甲噁硫磷、久效磷、moxidectin、三溴磷、伏杀硫磷、溴丙磷、pyraclofos、pyridaben、pyrimidifen、tebufenpyrad、thuringiensin、triarathene和4-溴-2-(4-氯苯基)-1-(乙氧基甲基)-5-(三氟甲基-1H-吡咯-3-腈(AC 303630))。

可按本发明使用的活性化合物还可存在于其市售制剂和由这些制剂制得的使用形式中，如和增效剂的混合物。增效剂为强化活性化合物作用的化合物，而加入的增效剂本身不一定是活性的。

由市售制剂制得的使用形式中的活性化合物的含量可在一个很宽的限度内变化。活性化合物在使用形式中的浓度可为0.0000001%至9.5%（重量）活性化合物，优选0.0001%至1%（重量）。

本化合物以适用于使用形式的习用方法进行使用。

当用于对付卫生领域的害虫和储存产品的害虫时，活性化合物对木材和粘土表现出极好的残效作用并对施用了石灰的基质中的碱具有好的稳定性。

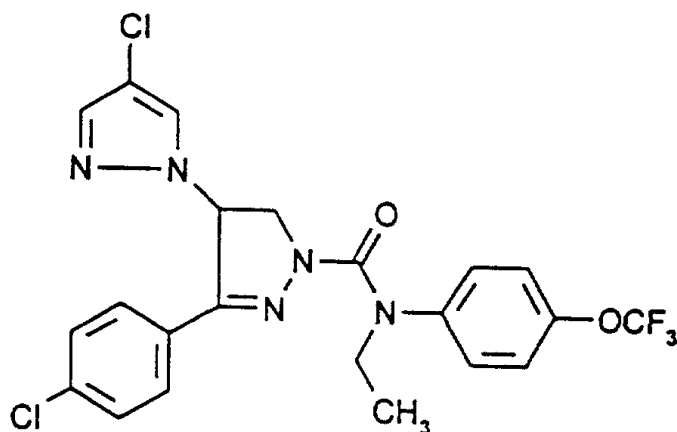
本发明的化合物还适于清除动物和家畜饲养中的昆虫、螨、蟑等，通过清除害虫可获得更好的结果，为了得到更高的奶产量、更大的体重、更具吸引力的动物毛皮，更长的寿命等。

本发明活性化合物在本领域的应用可用已知的方式进行，如以泡、喷、倒上、泼上或撒粉等形式外用，或以注射形式经非经肠方式使用，以及通过饲喂的方法使用。另外，也可以成形物（项圈、耳饰）形式以及以所谓的环境处理的形式使用。

本发明的化合物的制备和生物有效性结合下列实施例进行说明。

制备实施例

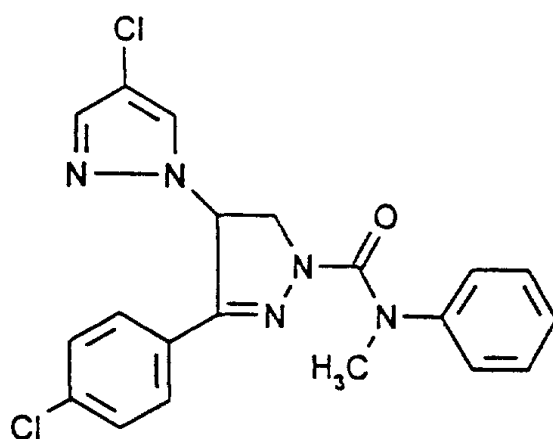
实施例 1



将 5 克 N - (4 - 三氟甲氧基) - 3 - (4 ' - 氯苯基) - 4 - (1 " H - 4 " - 氯吡唑 - 1 " - 基) - 4 , 5 - 二氢 - 1 - 吡唑甲酰胺溶于 5 0 毫升二甲基甲酰胺中，并在 2 0 ~ 4 0 ° C 搅拌下向其中加入 0.5 克氯化钠。然后加入 2.8 克乙基溴，混合物在 8 0 ° C 加热

4-5分钟。冷却后，反应混合物倾入150毫升水中，此混合物然后以2×100ml氯仿萃取。合并有机相，用硫酸镁干燥，然后真空蒸发。残留的晶状残余物用乙醇重结晶。得到0.9克N-(4-三氟甲氧基)-N-乙基-3-(4'-氯苯基)-4-(1''H-4''-氯吡唑-1''-基)-4,5-二氢-1-吡唑甲酰苯胺，为无色晶体，熔点153℃。或者不用重结晶法，而用硅胶色谱处理粗产物，用正己烷/丙酮(7:3)洗脱。

实施例 2



将2.8克3-(4'-氯苯基)-4-(1''H-4''-氯吡唑-1''-基)-4,5-二氢-1-吡唑啉溶于50毫升无水甲苯中，并加入1克吡啶。在50℃下加入1.7克N-甲基-N-苯基-氨基甲酰氯。混合物接着在40℃搅拌30分钟，在20℃搅拌10小时。然后将反应混合物倾入100毫升水中，分离有机相，用硫酸镁干燥，并真空浓缩。得到2克N-甲基-3-(4'-氯苯基)-4-(1''H-4''-氯吡唑-1''-基)-4,5-二氢-1-吡唑甲酰苯胺，为胶质油状物。

表2中的式(I)化合物按制备的一般知识，与类似于实施例1和

2 的方式制备，其中各自的基团 Z、R²、R³ 和 R⁴ 代表氢、X 代表氧：

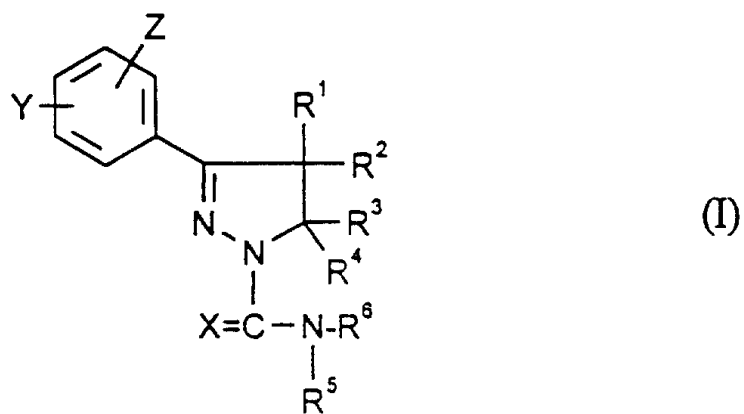


表 2

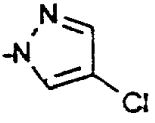
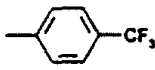
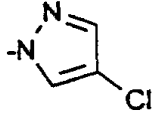
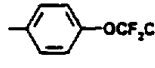
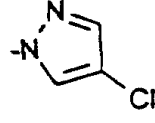

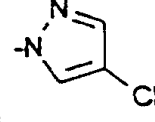

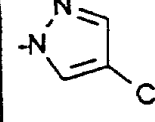

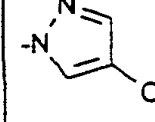
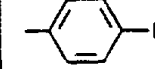
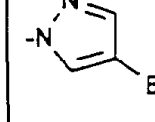
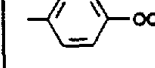
实施 例号	Y	R ¹	R ⁵	R ⁶	物理性质
3	4-Cl		C ₂ H ₅		熔点170°C
4	4-Cl		C ₂ H ₅		熔点135°C
5	4-Cl		CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅		熔点78°C
6	4-Cl		n-C ₄ H ₉		熔点158°C
7	4-Cl		n-C ₃ H ₇		熔点150°C
8	4-Cl		n-C ₄ H ₉		熔点158°C
9	4-Cl		C ₂ H ₅		熔点171°C

表 2 (续)

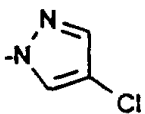
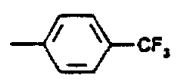
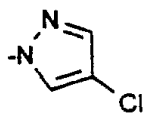
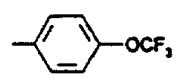
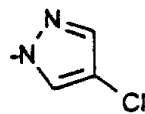
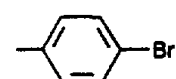
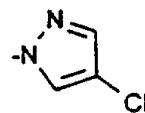
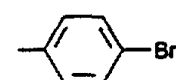
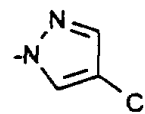
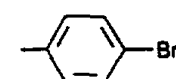
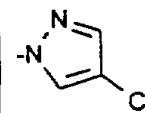
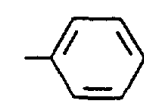
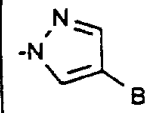
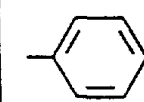
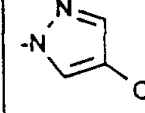
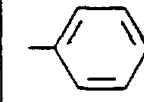
实施 例号	Y	R ¹	R ²	R ⁴	物理性质
10	4-Cl		CH ₃		熔点 191°C
11	4-Cl		CH ₂ -CH=CH ₂		熔点 135°C
12	4-F		C ₂ H ₅		熔点 127°C
13	4-Cl		C ₂ H ₅		熔点 176°C
14	4-F		n-C ₃ H ₇		熔点 114°C
15	H		CH ₃		油状物
16	4-F		CH ₃		油状物
17	4-OCHF ₂		CH ₃		油状物

表 2 (续)

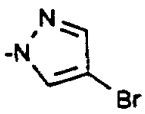
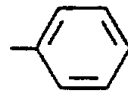
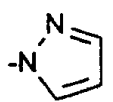
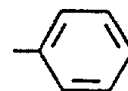
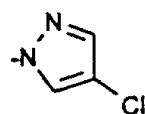
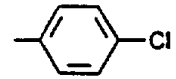
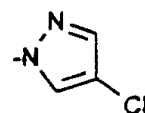
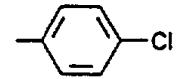
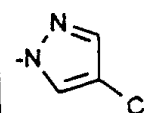
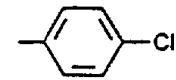
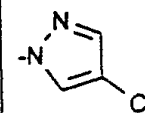

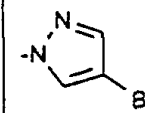

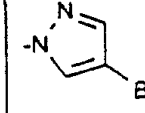
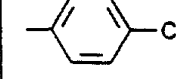
实施 例号	Y	R ¹	R ³	R ⁶	物理性质
18	4-Br		CH ₃		油状物
19	4-F		CH ₃		油状物
20	H		CN		熔点153°C
21	4-F		CN		熔点196°C
22	4-Cl		CN		熔点178°C
23	4-OCHF ₂		CN		熔点184°C
24	4-F		CN		熔点198°C
25	4-Br		CN		熔点196°C

表 2 (续)

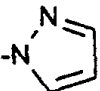
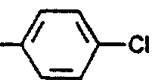
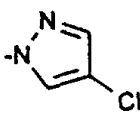
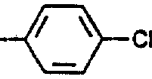
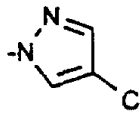
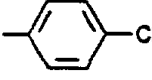
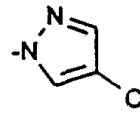
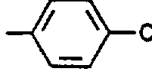
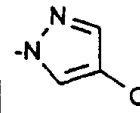
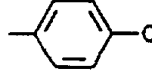
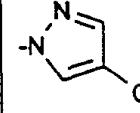

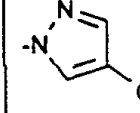
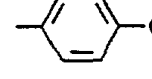
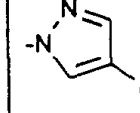
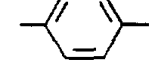
实施 例号	Y	R ¹	R ³	R ⁶	物理性质
26	4-F		CN		熔点172°C
27	4-Cl		CH ₃		熔点169°C
28	4-Cl		C ₂ H ₅		熔点154°C
29	4-Cl		n-C ₃ H ₇		
30	4-Cl		n-C ₄ H ₉		
31	4-Cl		i-C ₃ H ₇		熔点182°C
32	4-Cl		CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅		
33	4-Cl		CH ₂ -CH=CH ₂		

表 2 (续)

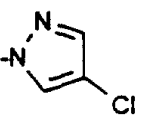

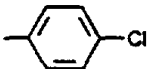
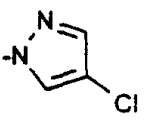
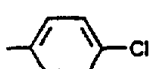
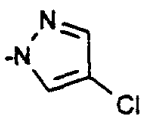
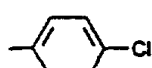
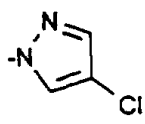
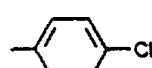
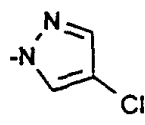

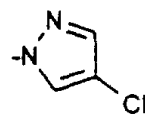

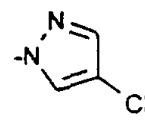

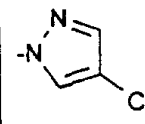
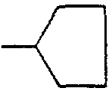
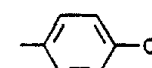
实施 例号	Y	R ¹	R ⁵	R ⁶	物理性质
34	4-Cl				
35	4-Cl		CHF ₂		
36	4-Cl		CH ₂ CH ₂ OCH ₃		
37	4-Cl		CH ₂ -C≡CH		
38	4-Cl		CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂		
39	4-Cl		CH ₂ COCH ₃		
40	4-Cl		CO ₂ CH ₃		
41	4-Cl				

表 2 (续)

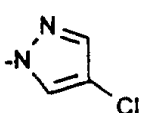
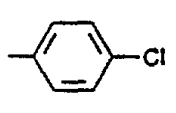
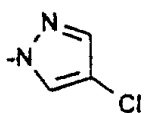
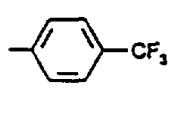
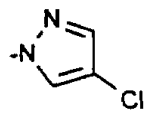
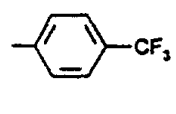
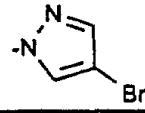
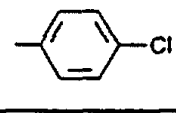
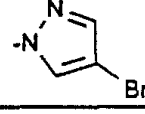
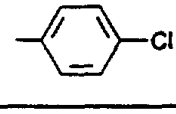
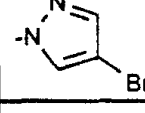
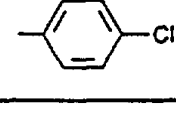
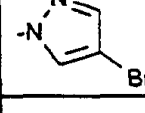
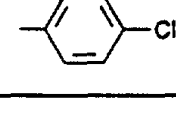
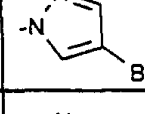
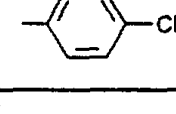
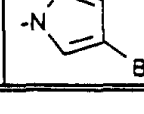
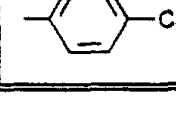
实施 例号	Y	R ¹	R ⁵	R ⁶	物理性质
42	4-Cl		s-C ₆ H ₅		
43	4-Cl		n-C ₇ H ₇		
44	4-Cl		CH ₂ CH=CH ₂		
45	4-Cl		C ₂ H ₅		
46	4-Cl		n-C ₇ H ₇		
47	4-Cl		CH ₃		熔点 164°C
48	4-Cl		i-C ₃ H ₇		熔点 198°C
49	4-Cl		CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅		
50	4-Cl		CH ₂ -CH=CH ₂		

表 2 (续)

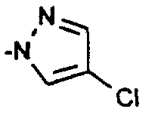
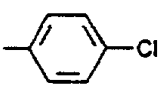
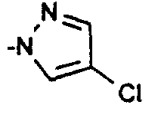
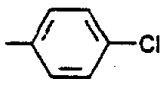
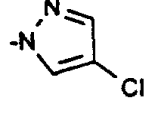
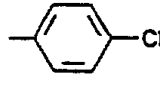
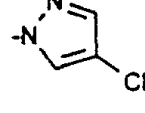
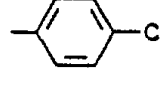
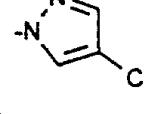
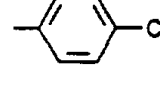
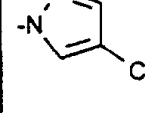
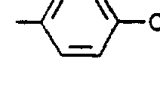
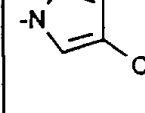
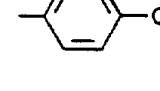
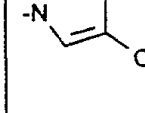
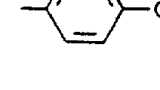
实施 例号	Y	R ¹	R ⁵	R ⁶	物理性质
51	4-F		CH ₃		
52	4-F		C ₂ H ₅		
53	4-F		n-C ₃ H ₇		
54	4-F		i-C ₃ H ₇		
55	4-F		n-C ₄ H ₉		
56	4-F		CH ₂ C≡CH		
57	4-F		CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅		
58	4-F		CH ₂ -CH=CH ₂		

表 2 (续)

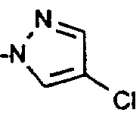
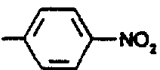
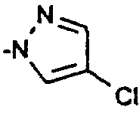
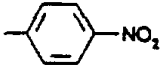
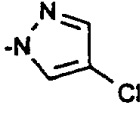
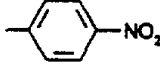
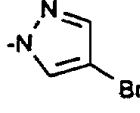
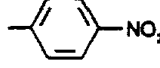
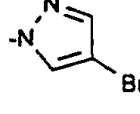
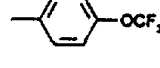
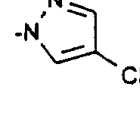

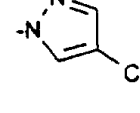
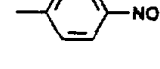
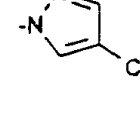
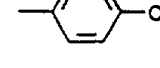
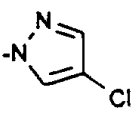
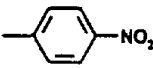
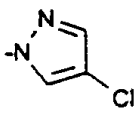
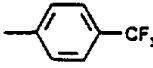
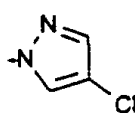
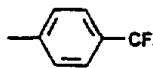
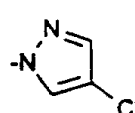
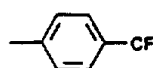
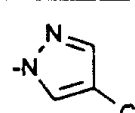
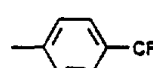
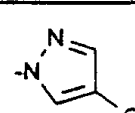
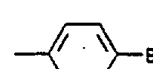
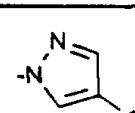
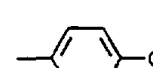
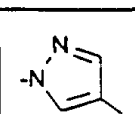

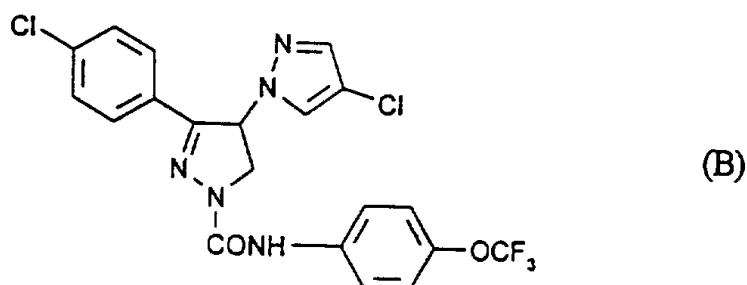
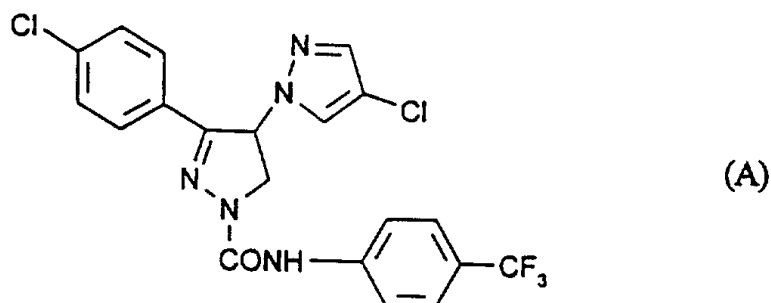
实施 例号	Y	R ¹	R ²	R ⁶	物理性质
59	4-Cl		CH ₃		熔点 172°C
60	4-Cl		C ₂ H ₅		
61	4-F		CH ₃		
62	4-Cl		CH ₃		熔点 172°C
63	4-Cl		n-C ₄ H ₉		熔点 101°C
64	4-Br		CH ₃		熔点 184°C
65	4-Br		CH ₃		熔点 165°C
66	4-OCHF ₂		CH ₃		熔点 176°C

表 2 (续)

实施 例号	Y	R ¹	R ²	R ⁶	物理性质
67	4-OCHF ₂		CH ₃		熔点 192°C
68	4-OCHF ₂		CH ₃		熔点 172°C
69	4-Br		CH ₃		熔点 174°C
70	4-Cl		CH ₃		熔点 188°C
71	4-Br		C ₂ H ₅		熔点 177°C
72	4-Br		C ₂ H ₅		熔点 172°C
73	4-Cl		n-C ₆ H ₁₃		油状物
74	4-Cl		-CH ₂ -C≡CH		熔点 190°C

在后的应用实施例中，在EP - A - 0 438 690中已知的化合物 (A)、(B) 用作比较物质。



应用实施例

实施例 A

辣根猿叶甲幼虫 (Phaedon larvae) 试验

溶剂： 7 份 (重量) 二甲基甲酰胺

乳化剂： 1 份 (重量) 烷基芳基聚乙二醇醚

制备活性化合物的适宜制剂时，将 1 份 (重量) 的活性化合物与所述量的溶剂和所述量的乳化剂混合，浓液用水稀释至所需浓度。

将甘兰叶 (Brassica oleracea) 浸入所需浓度的活性化合物制剂中进行处理，在叶子仍为湿的状态期间用辣根猿叶甲 (Phaedon cochleariae) 幼虫进行侵扰。

经过一定时间后，确定百分破坏率，100% 意味着所有辣根

猿叶甲幼虫都被杀死，0%意味着没有辣根猿叶甲幼虫被杀死。

在本实验中，例如制备实施例10、20和24的化合物在其活性化合物浓度为0.01%时，3天后达到100%的破坏率。

实施例B

菜蛾 (*Plutella*) 试验

溶剂：7份(重量)二甲基甲酰胺

乳化剂：1份(重量)烷基芳基聚乙二醇醚

制备活性化合物的适宜制剂时，将1份(重量)的活性化合物与所述量的溶剂和所述量的乳化剂混合，浓液用水稀释至所需浓度。

把甘兰叶 (*Brassica oleracea*) 浸入所需浓度的活性化合物制剂中进行处理，并在叶子仍为湿的状态时用菜蛾 (*Plutella maculipennis*) 毛虫进行侵扰。

经过一定时间后，确定百分破坏率，100%意味着所有菜蛾毛虫都被杀死，0%意味着没有菜蛾毛虫被杀死。

在本实验中，例如制备实施例10、3和4的化合物在其活性化合物浓度为0.001%时，在7天后达到100%的破坏率。

实施例C

美洲菸夜蛾 (*Heliothis virescens*) 试验

溶剂：7份(重量)二甲基甲酰胺

乳化剂：1份(重量)烷基芳基聚乙二醇醚

制备活性化合物的适宜制剂时，将1份(重量)的活性化合物与所述量的溶剂和所述量的乳化剂混合，浓液用水稀释至所需浓度。

把豆秧苗 (*Glycine max*) 浸入所需浓度的活性化合物制剂中进行处理，并在叶子仍为湿的状态时用美洲菸夜蛾 (*Heliothis*

Virescens) 进行侵扰。

经过一定时间后，确定百分破坏率，100%意味着所有美洲菸夜蛾都被杀死，0%意味着没有美洲菸夜蛾被杀死。

在本实验中，例如 制备实施例 10 的化合物在其活性化合物浓度为0.0001%时，在7天后达到90%的破坏率。

实施例 D

黑尾叶蝉 (Nephotettix) 试验

溶剂： 7份 (重量) 二甲基甲酰胺

乳化剂： 1份 (重量) 烷基芳基聚乙二醇醚

制备活性化合物的适宜制剂时，将1份 (重量) 的活性化合物与所述量的溶剂和所述量的乳化剂混合，浓液用水稀释至所需浓度。

把水稻秧苗 (*Oryza sativa*) 浸入所需浓度的活性化合物制剂中进行处理，并在秧苗仍为湿的状态时用黑尾叶蝉 (*Nephotettix*) 进行侵扰。

经过一定时间后，确定百分破坏率，100%意味着所有黑尾叶蝉都被杀死，0%意味着没有黑尾叶蝉被杀死。

在本实验中，例如 制备实施例 1 和 4 的化合物在其活性化合物浓度为0.01%时，6天后达到100%的破坏率。