

[19] 中华人民共和国国家知识产权局



[12] 发明专利说明书

专利号 ZL 200410055755.8

[51] Int. Cl.

C07D 207/40 (2006.01)

C07D 491/10 (2006.01)

C07D 309/28 (2006.01)

C07D 307/24 (2006.01)

A01N 43/08 (2006.01)

A01P 7/02 (2006.01)

[45] 授权公告日 2006 年 11 月 29 日

[11] 授权公告号 CN 1286809C

[51] Int. Cl. (续)

A01P 7/04 (2006.01)

[22] 申请日 1999.3.18

[21] 申请号 200410055755.8

分案原申请号 99806593.5

[30] 优先权

[32] 1998.3.26 [33] DE [31] 19813354.5

[71] 专利权人 拜尔公司

地址 联邦德国莱沃库森

[72] 发明人 F·利布 R·菲舍尔 A·格拉夫

U·施奈德尔 T·布雷特施奈德

C·埃尔德伦 W·安德施

M·W·德鲁斯 M·多林格

I·维特肖洛夫斯基

R·A·迈尔斯

审查员 李雪莹

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 王景朝

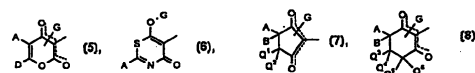
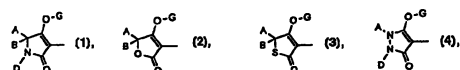
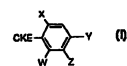
权利要求书 10 页 说明书 158 页

[54] 发明名称

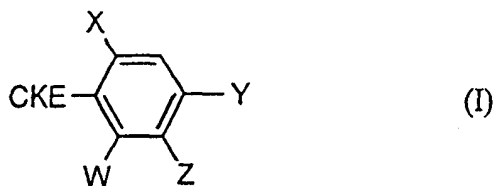
芳基苯基取代的环状酮烯醇类化合物

[57] 摘要

本发明涉及一种新的式(I)的芳基苯基取代的酮烯醇类,其中X表示卤素、烷基、烷氧基、链烯氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代链烯氧基、硝基、氰基或均任选地被取代的苯基、苯氧基、苯硫基、苯基烷氧基或苯基烷硫基;Z是可能被取代的环烷基、芳基或杂芳基;W和Z相互独立地各表示氢、卤素、烷基、烷氧基、链烯氧基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代链烯氧基、硝基或氰基,CKE表示下列基团(1)、(2)、(3)、(4)、(5)、(6)、(7)或(8)之一,其中A、B、D、G和Q¹至Q⁶具有说明书中给出的含义。本发明还涉及几种生产所述的酮烯醇类的方法及其作为有害生物防治剂和除草剂的应用。



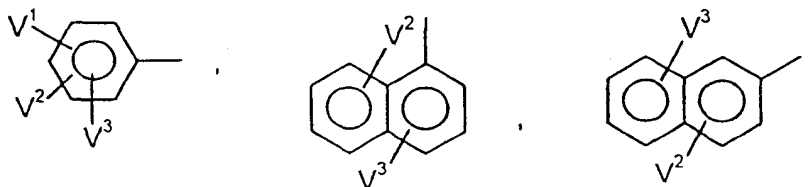
1. 式(I)化合物



其中

X 表示卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_3-C_6 -链烯氧基、 C_1-C_6 -烷硫基、 C_1-C_6 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 -烷基磺酰基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -卤代链烯氧基、硝基、氰基，

Z 表示下列基团之一：

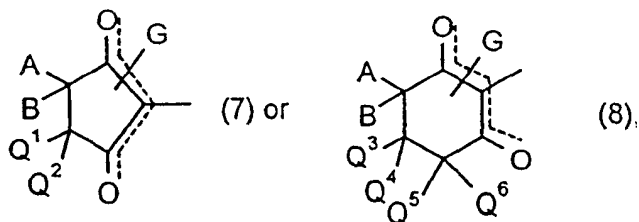


V^1 表示氢、卤素、 C_1-C_{12} -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷硫基、 C_1-C_6 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、硝基、氰基，

V^2 和 V^3 相互独立地各表示氢、卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基或 C_1-C_4 -卤代烷氧基，

W 和 Y 相互独立地各表示氢、卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、硝基或氰基，

CKE 表示下列基团之一



A 表示氢或均任选由卤素取代的 C_1-C_{12} -烷基、 C_3-C_8 -链烯基、 C_1-C_{10} -烷氧基- C_1-C_8 -烷基、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基、 C_1-C_{10} -烷硫基- C_1-C_6 -烷基、任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-或 C_1-C_6 -烷氧基-取代的其中任选地一或二个不直接相邻的环成员由氧和 / 或硫替代的 C_3-C_8 -环烷基,

B 表示氢、 C_1-C_{12} -烷基或 C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基, 或

A、B 和其连接的碳原子表示饱和 C_3-C_{10} -环烷基或不饱和 C_5-C_{10} -环烷基, 其中任选地一个环成员由氧或硫替代, 且它们任选由 C_1-C_8 -烷基、 C_3-C_{10} -环烷基、 C_1-C_8 -卤代烷基、 C_1-C_8 -烷氧基、 C_1-C_8 -烷硫基、卤素或苯基单或二取代,

Q^1 表示氢或 C_1-C_4 -烷基,

Q^2 、 Q^4 、 Q^5 和 Q^6 相互独立地各表示氢或 C_1-C_4 -烷基,

Q^3 表示氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_6 -烷硫基- C_1-C_2 -烷基、任选由 C_1-C_4 -烷基-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3-C_8 -环烷基,

G 表示氢(a)或表示下列基团之一:



其中

L 表示氧或硫, 和

M 表示氧或硫,

R^1 表示均可任选由卤素-取代的 C_1-C_{20} -烷基、 C_2-C_{20} -链烯基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基、 C_1-C_8 -烷硫基- C_1-C_8 -烷基、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基或任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-或 C_1-C_6 -烷氧基-取代的其中任选地一或多个不直接相邻的环成员由氧和 / 或硫替代的 C_3-C_8 -环烷基,

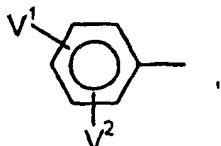
R^2 表示均可任选由卤素-取代的 C_1-C_{20} -烷基、 C_2-C_{20} -链烯基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_2-C_8 -烷基、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_2-C_8 -烷基,

表示任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-或 C_1-C_6 -烷氧基-取代的 C_3-C_8 -环烷基。

2. 权利要求 1 的式 (I) 化合物, 其中

X 表示氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_3-C_4 -链烯氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_4 -卤代链烯氧基、硝基或氰基,

Z 表示下列基团之一:

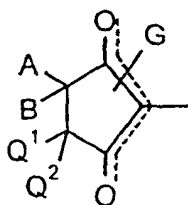


V^1 表示氢、氟、氯、溴、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_2 -卤代烷基、 C_1-C_2 -卤代烷氧基、硝基、氰基,

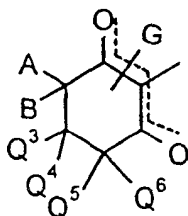
V^2 表示氢、氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_2 -卤代烷基或 C_1-C_2 -卤代烷氧基,

W 和 Y 相互独立地各表示氢、氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -卤代烷氧基,

CKE 表示下列基团之一:



(7),



(8),

A 表示氢, 或表示均可任选由氟-或氯-取代的 C_1-C_{10} -烷基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基、任选由氟-、氯-、 C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的其中任选地一个环成员由氧或硫替代的 C_3-C_7 -环烷基,

B 表示氢或 C_1-C_6 -烷基, 或

A、B 和其连接的碳原子表示饱和或不饱和的 C_5-C_7 -环烷基, 其中任选地一个环成员由氧或硫替代且其任选由 C_1-C_6 -烷基、 C_5-C_8 -环烷基、 C_1-C_3 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、氟、氯或苯基单取代,

Q^1 表示氢,

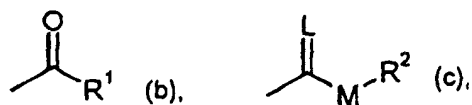
Q^2 表示氢,

Q^4 、 Q^5 和 Q^6 相互独立地各表示氢或 C_1-C_3 -烷基,

Q^3 表示氢、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_4 -烷硫

基- C_1-C_2 -烷基或任选由甲基-或甲氧基-取代的、其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3-C_6 -环烷基,

G 表示氢(a)或表示下列基团之一:



其中

L 表示氧或硫, 和

M 表示氧或硫,

R^1 表示均可任选由氟-或氯-取代的 C_1-C_{16} -烷基、 C_2-C_{16} -链烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷硫基- C_1-C_6 -烷基、多- C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基或任选由氟-、氯-、 C_1-C_5 -烷基或 C_1-C_5 -烷氧基-取代的其中任选地一或二个不直接相连的环成员由氧和/或硫替代的 C_3-C_7 -环烷基,

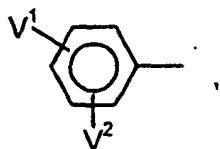
R^2 表示均可任选由氟-取代的 C_1-C_{16} -烷基、 C_2-C_{16} -链烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_2-C_6 -烷基或多- C_1-C_6 -烷氧基- C_2-C_6 -烷基,

表示任选由氟-、氯-、 C_1-C_4 -烷基-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的 C_3-C_7 -环烷基。

3. 权利要求 1 的式(I)化合物, 其中

X 表示氟、氯、甲基、乙基、丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、三氟甲基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、硝基或氰基,

Z 表示下列基团之一:

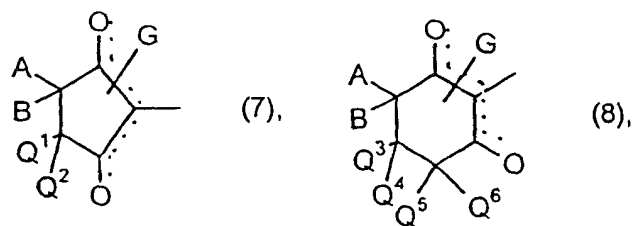


V^1 表示氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、硝基、氰基,

V^2 表示氢、氟、氯、甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、三氟甲基或三氟甲氧基,

W 和 Y 相互独立地各表示氢、氟、氯、甲基、乙基、正丙基、甲氧基、乙氧基或丙氧基,

CKE 表示下列基团之一:



A 表示氢,或表示各任选由氟-取代的 C_1-C_8 -烷基或 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、任选由氟-、甲基-、乙基-或甲氧基-取代的其中任选地一个环成员由氧或硫替代的 C_3-C_6 -环烷基,

B 表示氢或 C_1-C_4 -烷基,或

A、B 与其连接的碳原子一起表示饱和的 C_3-C_6 -环烷基,其中任选地一个环成员由氧或硫替代且它任选由甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、氟或氯取代,

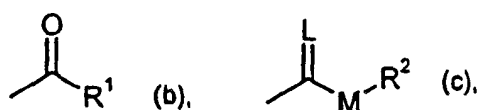
Q^1 表示氢,

Q^2 表示氢,

Q^4 、 Q^5 和 Q^6 相互独立地表示氢、甲基或乙基,

Q^3 表示氢、甲基、乙基或其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3-C_6 -环烷基,

G 表示氢(a)或表示下列基团之一:



其中

L 表示氧或硫, 和

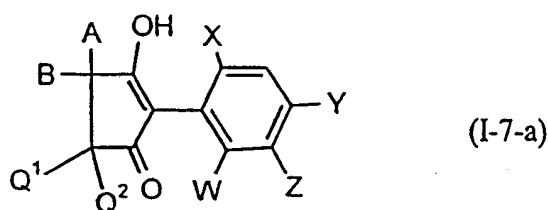
M 表示氧或硫,

R^1 表示均可任选由氟-或氯-取代的 C_1-C_{14} -烷基、 C_2-C_{14} -链烯基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_4 -烷硫基- C_1-C_6 -烷基、多- C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基或任选由氟-、氯-、甲基-、乙基-、丙基-、异丙基-、丁基-、异丁基-、叔丁基-、甲氧基-、乙氧基-、正丙氧基-或异丙氧基-取代的 C_3-C_6 -环烷基, 该环烷基中任选地一或二个不直接相邻的环成员由氧和 / 或硫替代,

R^2 表示均可任选由氟-取代的 C_1-C_{14} -烷基、 C_2-C_{14} -链烯基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_2-C_6 -烷基或多- C_1-C_4 -烷氧基- C_2-C_6 -烷基,

表示任选由氟-、氯-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-或甲氧基-取代的 C_3-C_6 -环烷基。

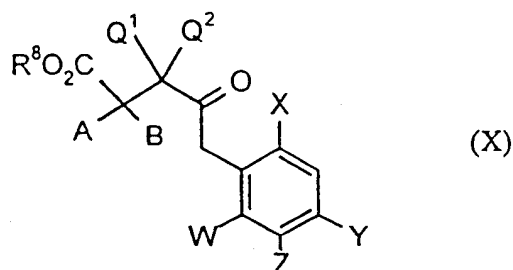
4. 制备权利要求 1 的式 (I) 化合物的方法, 其特征在于,
(G) 式 (I-7-a) 化合物



其中

A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y 和 Z 各如权利要求 1 中所定义
如下获得

使式 (X) 的酮羧酸酯

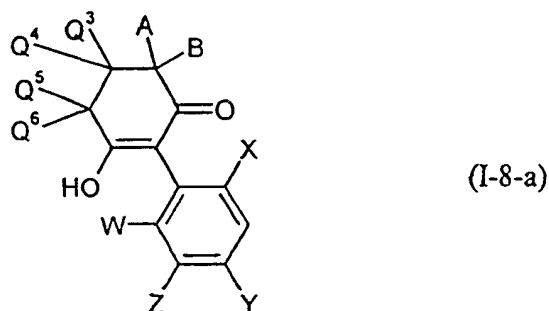


其中

A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y 和 Z 各如权利要求 1 中所定义，和
 R^8 表示烷基

如果适宜在稀释剂存在下和在碱存在下，进行分子内环化；

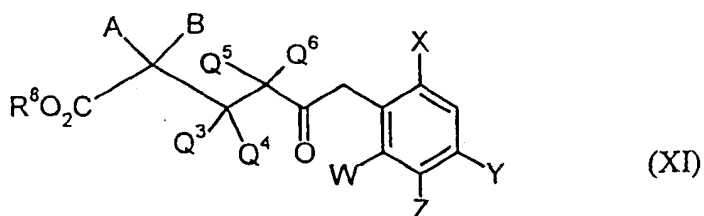
(H) 式 (I-8-a) 化合物



其中

A、B、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、W、X、Y 和 Z 各如权利要求 1 中所定义
 如下获得

使式 (XI) 的 6-芳基-5-酮基-己酸酯



其中

A、B、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、W、X、Y 和 Z 各如权利要求 1 中所定义
 和

R^8 表示烷基

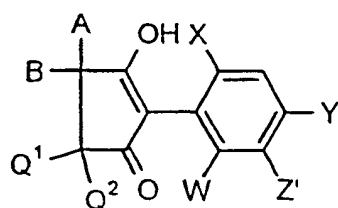
在稀释剂存在下和在碱存在下进行分子内缩合；

或

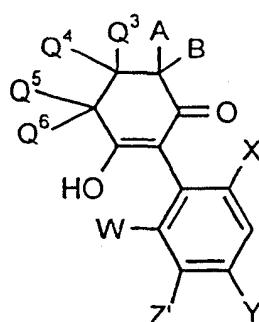
(I) 如上所示的式 (I-7-a) 至式 (I-8-a) 化合物，其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、W、X、Y 和 Z 各如权利要求 1 中所定义，如下获得：

在溶剂、碱和催化剂存在下，使式 (I-7'-a) 至 (I-8'-a) 化合物

(I-7'-a):



(I-8'-a):

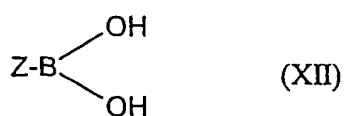


其中

A、B、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X和Y各如权利要求1中所定义，和

Z' 表示氯、溴或碘，

与式(XII)的硼酸反应



其中

Z 如权利要求1中所定义，

随后，所得的式(I-7-a)至(I-8-a)化合物在每一种情况下，

(J α) 与式(XIII)的酰基卤



其中

R¹ 如权利要求1中所定义，和

Hal 表示卤素，

或

(β) 与式(XIV)羧酸酐



其中

R^1 如权利要求 1 中所定义,

如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下反应,

或在每一种情况下,

(K) 如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下,
与式 (XV) 的氯代甲酸酯或氯代甲酸硫酸酯反应



其中

R^2 和 M 如权利要求 1 中所定义,

或在每一种情况下,

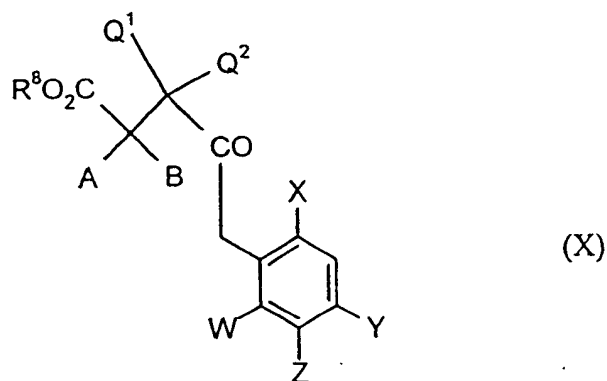
(L) 如果适宜在稀释剂存在下, 和如果适宜在酸结合剂存在下,
与式 (XVI) 的氯代单硫代甲酸酯或氯代二硫代甲酸酯反应



其中

M 和 R^2 如权利要求 1 中所定义。

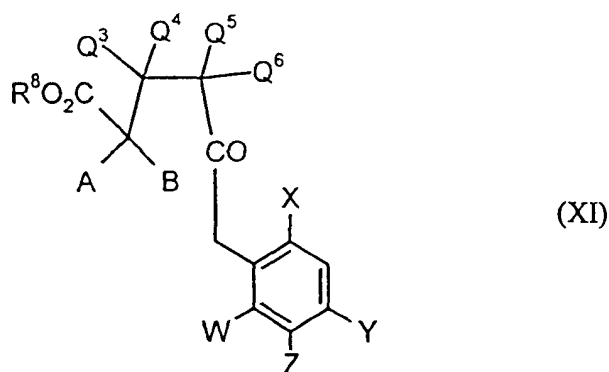
5. 式 (X) 化合物



其中

A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y和Z各如权利要求1中所定义，和
 R^8 表示烷基。

6. 式(XI)化合物



其中

A、B、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、W、X、Y和Z各如权利要求1中所定义，
 和

R^8 表示烷基。

7. 杀虫剂和/或除草剂，其特征在于，它们含有至少一种权利要求1的式(I)化合物。

8. 权利要求1的式(I)化合物在作物保护、家居方面、卫生方面和贮存产品的保护上防治有害生物的应用。

9. 在作物保护、家居方面、卫生方面和贮存产品的保护上防治有害生物的方法，其特征在于，使权利要求1的式(I)化合物作用于有害生物和/或其栖生地。

10. 制备杀虫剂和/或除草剂的方法，其特征在于，将权利要求1的式(I)化合物与扩充剂和/或表面活性剂混合。

芳基苯基取代的环状酮烯醇类化合物

本申请是申请日为1999年3月18日、申请号为99806593.5(国际申请号为PCT/99EP/01787)的专利申请的分案申请。

技术领域

本发明涉及新的芳基苯基-取代的环状酮烯醇类,涉及其多种制备方法及其作为杀虫剂和除草剂的应用。

背景技术

3-酰基-吡咯烷-2,4-二酮类的药物性能已有过报道(S. Suzuki 等,《化学药物公报》[Chem. Pharm. Bull.]15, 1120(1967))。再者, R. Schmierer 和 H. Mildenberger 合成了 N-苯基吡咯烷-2,4-二酮类(Liebigs Ann. Chem. 1985, 1095)。未曾描述这些化合物的生物活性。

EP-A-0 262 399 和 GB-A-2 266 888 公开了相似结构的化合物(3-芳基-吡咯烷-2,4-二酮类),然而,它们的除草、杀虫或杀螨活性是未知的。未取代的双环状3-芳基-吡咯烷-2,4-二酮衍生物(EP-A-355 599 和 EP-415 211)和取代的单环状3-芳基-吡咯烷-2,4-二酮衍生物(EP-A-377 893 和 EP-442 077)具有除草、杀虫或杀螨活性是已知的。

同样已知的还有多环状3-芳基吡咯烷-2,4-二酮衍生物(EP-442 073)和1H-芳基吡咯烷-二酮衍生物(EP-456 063、EP-521 334、EP-596 298、EP-613 884、EP-613 885、WO 94/01 997、WO 95/26 954、WO 95/20 572、EP-A-0 668 267、WO 96/25 395、WO 96/35 664、WO 97/01 535、WO 97/02243 和 WO 97/36 868、DE-19 716 591)。

已知某些取代的 Δ^3 -二氢呋喃-2-酮衍生物具有除草性能(参见, DE-A-4 014 420)。季酮酸衍生物用作起始原料的合成(例如, 3-(2-甲基-苯基)-4-羟基-5-(4-氟苯基)- Δ^3 -二氢呋喃-2-酮)同样描述于 DE-A-4 014 420 中。类似结构的化合物由 Campbell 等发表于 J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1, 1985, (8)1567-76 中的文献已知,但未提到杀虫和/或杀螨活性。再者,具有除草、杀螨和杀虫性能的3-芳基- Δ^3 -二氢呋喃酮衍生物由 EP-A-528 156、EP-A-0 647 637、WO 95/26 345、WO 96/20 196、WO 96/25 395、WO 96/35 664、WO 97/01 535、WO 97/02243 和 WO 97/36 868、DE-19 716 591 已知。

3-芳基- Δ^3 -二氢噻吩-酮衍生物同样是已知的(WO 95/26 345、WO 96/25 395、WO 97/01 535、WO 97/02243、WO 97/36 868、DE-19 716 591)。

同样由文献已知的还有某些 3H-吡唑-3-酮衍生物,例如,1,2-二乙基-1,2-二氢-5-羟基-4-苯基-3H-吡唑-3-酮或{[5-氧代-1,2-二苯基-4-(对磺基苯基)-3-吡唑啉-3-基]-氧基}二钠盐,或对-(3-羟基-5-氧代-1,2-二苯基-3-吡唑啉-4-基)-苯磺酸(参见,《杂环化学杂志》[J. Heterocycl. Chem.] 25(5), 1301-1305, 1988 或《杂环化学杂志》[J. Heterocycl. Chem.], 25(5), 1307-1310, 1988 或 Zh. Obshch. Khim., 34(7), 2397-2402, 1964)。然而,未曾描述这些化合物的生物活性。

再者,已知 4,4',4''-(5-羟基-3-氧代-1H-吡唑-1,2,4(3H)-三基)-三-苯磺酸三钠具有药物性能(参见, Farmakol. Toksikol. (莫斯科), 38(2), 180-186, 1976)。然而,未见用在作物保护上。

而且,EP-508 126 和 WO 92/16 510、WO 96/21 652 描述了 4-芳基吡咯烷-3,5-二酮衍生物具有除草、杀螨和杀虫性能。此外,4-芳基吡唑烷类是已知的,其杀真菌性能曾有过描述(WO 96/36 229、WO 96/36 615、WO 96/36 616、WO 96/36 633)。

某些在苯环上未取代的苯基-吡喃酮衍生物是已知的(参见, A.M. Chirazi, T. Kappe & E. Ziegler, Arch. Pharm. 309 558(1976) 和 K.-H. Boltze 和 K. Heidenbluth, Chem. Ber. 91, 2849)。未提到这些化合物作为农药使用的可能。在苯环上被取代且具有除草、杀螨和杀虫作用的苯基吡喃酮衍生物描述于 EP-A-588 137、WO 96/25 395、WO 96/35 664、WO 97/01 535、WO 97/02 243、WO 97/16 436、WO 97/19 941、WO 97/36 868 和 DE-19 716 591。

某些在苯环上未取代的 5-苯基-1,3-噻嗪衍生物也是已知的(参见, E. Ziegler 和 E. Steiner, Monatsh. 95, 147(1964), R. Ketcham, T. Kappe 和 E. Ziegler, 《杂环化学杂志》[J. Heterocycl. Chem.] 10, 223(1973), 未提到这些化合物作为农药使用的可能。在苯环上取代且具有除草、杀螨和杀虫活性的 5-苯基-1,3-噻嗪描述于 WO 94/14 785、WO 96/02 539、WO 96/35 664、WO 97/01 535、WO 97/02 243、WO 97/02 243、WO 97/36 868 中。

已知某些取代的 2-芳基环戊烷二酮具有除草和杀螨性能(参见,例

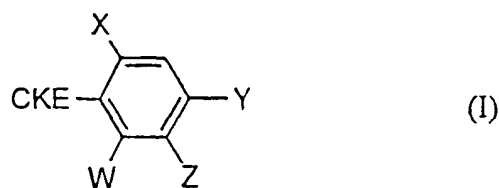
如, US-4 283 348; 4 338 122; 4 436 666; 4 526 723; 4 551 547; 4 632 698; WO 96/01 798; WO 96/03 366 和 WO 97/14 667)。而且, 相似结构的化合物是已知的: 3-羟基-5, 5-二甲基-2-苯基环戊-2-烯-1-酮, 由 Micklefield 等发表于《四面体》[Tetrahedron], (1992), 7519-26 和天然产物 involutine (-)-顺-5-(3, 4-二羟基苯基)-3, 4-二羟基-2-(4-羟基苯基)-环戊-2-烯-酮, 由 Edwards 等发表于 J. Chem. Soc. S, (1967), 405-9。未描述杀虫和杀螨活性。而且, 2-(2, 4, 6-三甲基苯基)-1, 3-二氢化茚二酮, 发表于《经济昆虫学杂志》[J. Economic Entomology] 66, (1973), 584 和德国专利公开 DE-2 361 084, 提到除草和杀螨活性。

已知某些取代的 2-芳基环己二酮具有除草和杀螨性能(US-4 175 135, 4 209 432, 4 256 657, 4 256 658, 4 256 659, 4 257 858, 4 283 348, 4 303 669, 4 351 666, 4 409 153, 4 436 666, 4 526 723, 4 613 617, 4 659 372, DE-2 813 341, 以及 Wheeler, T.N., 《有机化学杂志》[J. Org. Chem.], 44, 4906(1979))。

然而, 这些化合物的活性与活性谱, 特别是在低施用剂量和浓度下, 并不总是完全令人满意的。再者, 这些化合物与植物相适性不总是令人满意的。

发明内容

因此, 本发明提供新的式(I)化合物



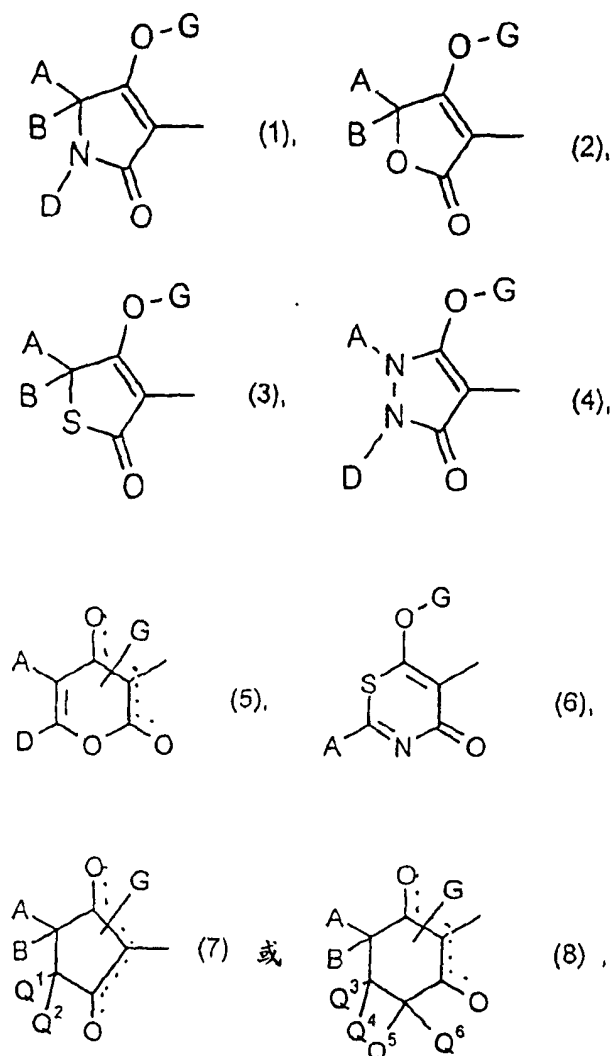
其中

X 表示卤素、烷基、烷氧基、链烯氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代链烯氧基、硝基、氰基或均任选被取代的苯基、苯氧基、苯硫基、苯基烷氧基或苯基烷硫基,

Z 表示均可任选取代的环烷基、芳基或杂芳基,

W 和 Y 相互独立地各表示氢、卤素、烷基、烷氧基、链烯氧基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代链烯氧基、硝基或氰基,

CKE 表示下列基团之一:



其中

A 表示氢，均任选由卤素取代的烷基、链烯基、烷氧基烷基、多烷氧基烷基、烷硫基烷基、饱和或不饱和的任选至少一个环原子由杂原子替代的任选取代的环烷基，或均任选由卤素-、烷基-、卤代烷基-、烷氧基-、卤代烷氧基-、氰基-或硝基-取代的芳基、芳烷基或杂芳基，

B 表示氢、烷基或烷氧基烷基，或

A 和 B 与其连接的碳原子一起表示一个饱和或不饱和的未取代或取代的环，该环任选地含有至少一个杂原子，

D 表示氢或一个任选取代的选自下列的基团：烷基、链烯基、

炔基、烷氧基烷基、多烷氧基烷基、烷硫基烷基、饱和或不饱和的有一或多个环成员任选地由杂原子替代的环烷基，芳烷基、芳基、杂芳基烷基或杂芳基，或

A 和 D 与其连接的碳原子一起表示一个饱和或不饱和的环，该环在 A、D 部分是未取代或取代的且它任选地含有至少一个(在其中 CKE = (4) 的情况下另外的)杂原子，或

A 和 Q¹ 一起表示烷二基或链烯二基，它们各任选由在每种情况下均为任选取代的烷基、羟基、烷氧基、烷硫基、环烷基、苄氧基或芳基取代，或

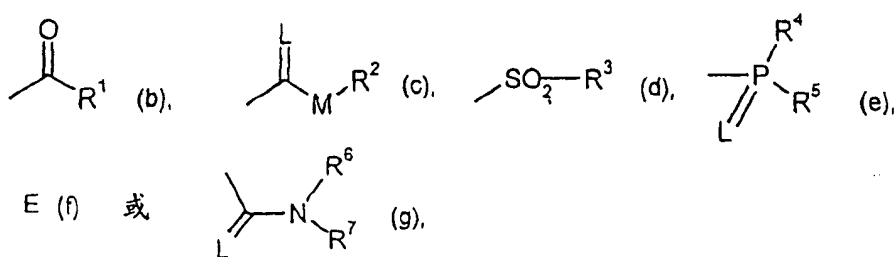
Q¹ 表示氢或烷基，

Q²、Q⁴、Q⁵ 和 Q⁶ 相互独立地各表示氢或烷基，

Q³ 表示氢、烷基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、任选取代的环烷基(其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代)或任选取代的苯基，或

Q³ 和 Q⁴ 与其连接的碳原子一起表示一个饱和或不饱和的未取代或取代的任选地含有杂原子的环，

G 表示氢(a)或表示下列基团之一：



其中

E 表示金属离子或铵离子，

L 表示氧或硫，

M 表示氧或硫，

R¹ 表示均任选由卤素-取代的烷基、链烯基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、多烷氧基烷基或任选由卤素-、烷基-或烷氧基-取代的可以间入至少一个杂原子的环烷基，均任选取代的苯基、苯基烷基、杂芳基、苯氧基烷基或杂芳氧基烷基，

R² 表示均任选由卤素-取代的烷基、链烯基、烷氧基烷基、多烷

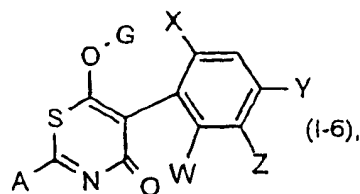
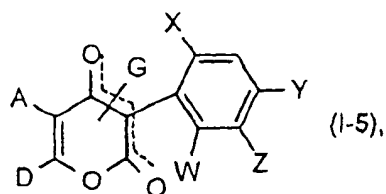
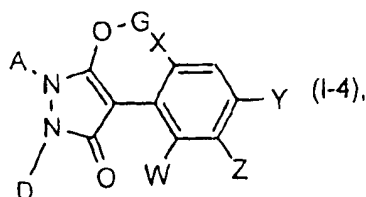
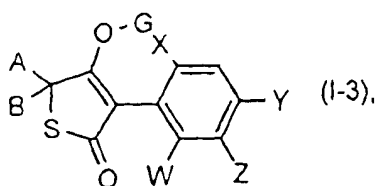
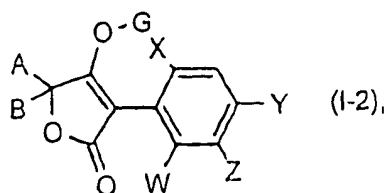
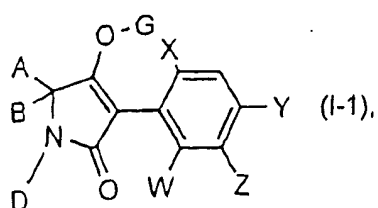
氧基烷基或表示均任选取代的环烷基、苯基或苄基,

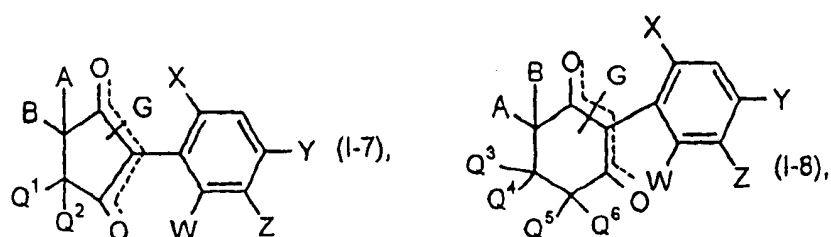
R^3 、 R^4 和 R^5 相互独立地各表示均任选由卤素取代的烷基、烷氧基、烷基氨基、二烷基氨基、烷硫基、链烯硫基、环烷基硫基或表示均任选取代的苯基、苄基、苯氧基或苯硫基, 和

R^6 和 R^7 相互独立地各表示氢, 均任选由卤素取代的烷基、环烷基、链烯基、烷氧基、烷氧基烷基, 表示任选取代的苯基, 表示任选取代的苄基, 或与其连接的氮原子一起表示一个任选间入氧或硫的环。

取决于特别是取代基的性质, 式(I)化合物可以以各种组成的几何和/或光学异构体或异构体混合物存在, 如果需要, 它们可以用常规方式分离。本发明提供纯异构体和异构体混合物, 其制备和应用以及包含它们的组合物。然而, 在下文中, 为简明起见, 总是提到式(I)化合物, 虽然是要包括纯化合物和如果适宜具有不同比例的异构体化合物的混合物二者。

包括基团 CKE 的含意(1)至(8), 产生下列主结构(I-1)至(I-8):



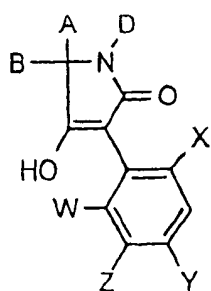


其中

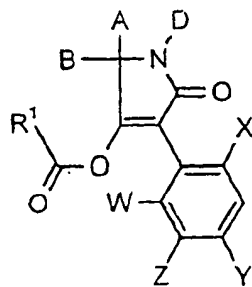
A、B、D、G、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y和Z各如上定义。

包括基团G的各种含意(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)和(g)，
如果CKE表示基团(1)，则产生下列主结构(I-1-a)至(I-1-g)，

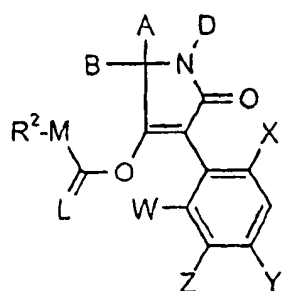
(I-1-a):



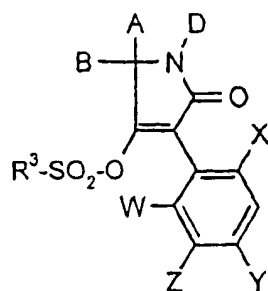
(I-1-b):



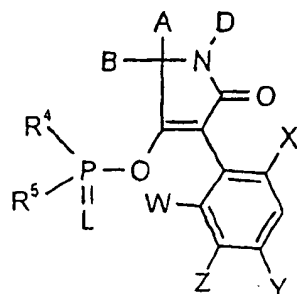
(I-1-c):



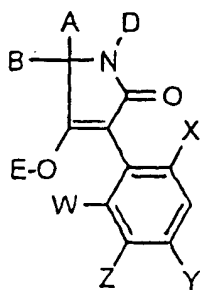
(I-1-d):



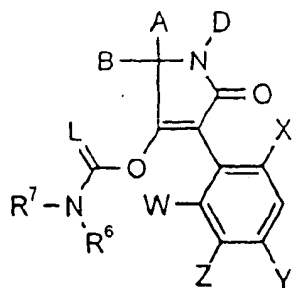
(I-1-e):



(I-1-f):



(I-1-g):

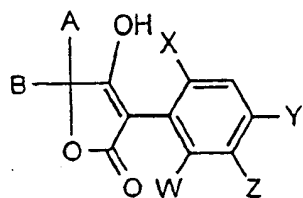


其中

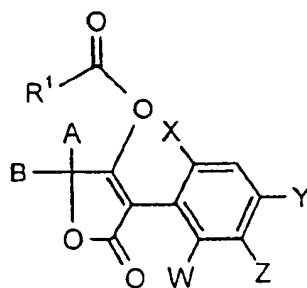
A、B、D、E、L、M、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和R⁷各如上定义。

包括基团G的各种含意(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)和(g)，如果CKE表示基团(2)，则产生下列主结构(I-2-a)至(I-2-g)，

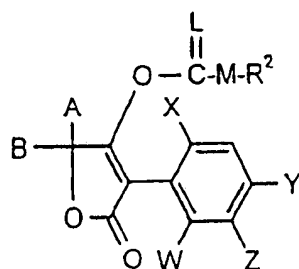
(I-2-a):



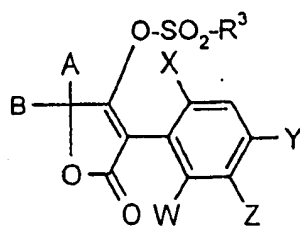
(I-2-b):



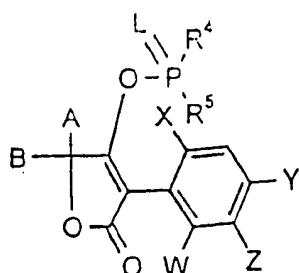
(I-2-c):



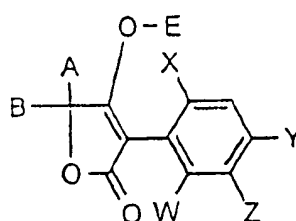
(I-2-d):



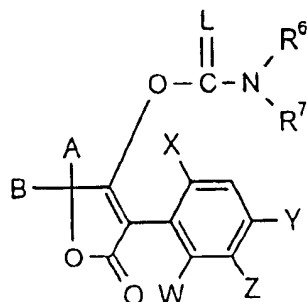
(I-2-e):



(I-2-f):



(I-2-g):

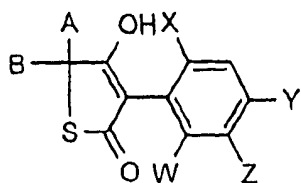


其中

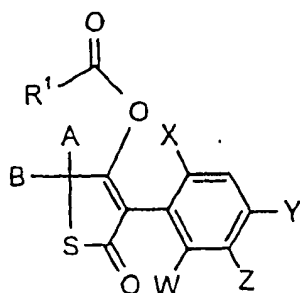
A、B、E、L、M、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和R⁷各如上定义。

包括基团G的各种含意(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)和(g)，
如果CKE表示基团(3)，则产生下列主结构(I-3-a)至(I-3-g)，

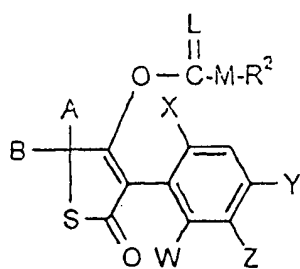
(I-3-a):



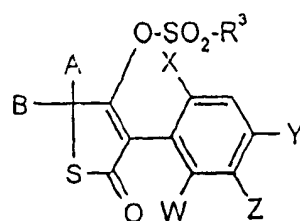
(I-3-b):



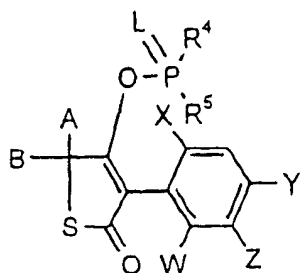
(I-3-c):



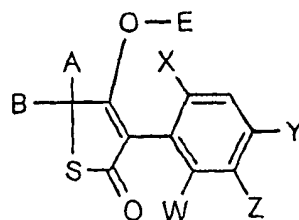
(I-3-d):



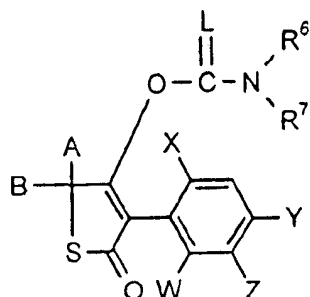
(I-3-e):



(I-3-f):



(I-3-g):

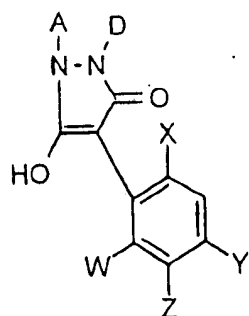


其中

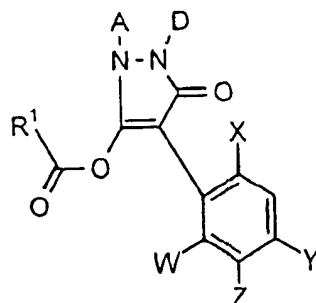
A、B、E、L、M、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和R⁷各如上定义。

包括基团 G 的各种含意 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g),
如果 CKE 表示基团 (4), 则产生下列主结构 (I-4-a) 至 (I-4-g),

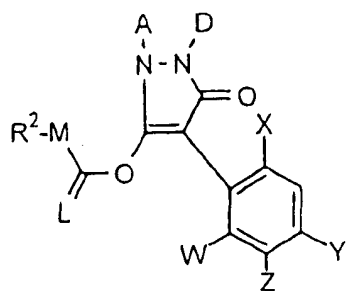
(I-4-a):



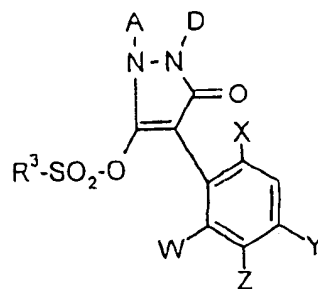
(I-4-b):



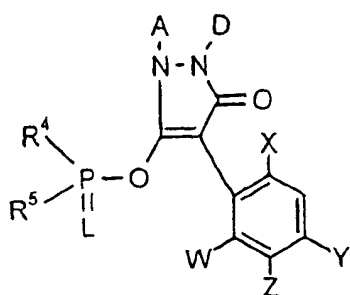
(I-4-c):



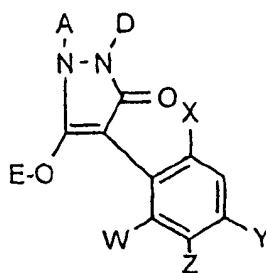
(I-4-d):



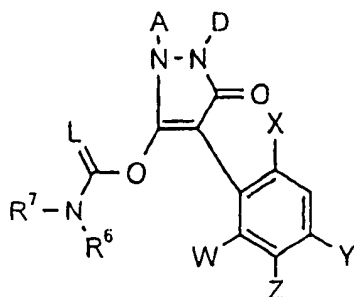
(I-4-e):



(I-4-f):



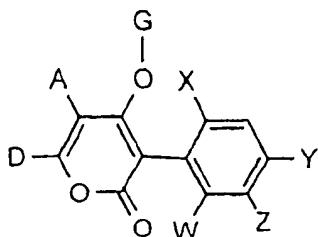
(I-4-g):



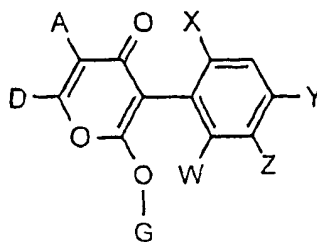
其中

A、D、E、L、M、W、X、Y、Z、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 和 R^7 各如上定义。

取决于取代基 G 的位置，式(I-5)化合物可以以式(I-5-A)和(I-5-B)这二种异构体形式存在，



(I-5-A)



(I-5-B)

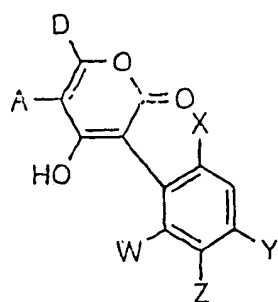
它将由式中(I-5)的虚线表示。

式(I-5-A)和(I-5-B)化合物可以以混合物或其纯异构体形式存在。式(I-5-A)和(I-5-B)化合物的混合物如果需要可以用本身已知的方式通过物理方法例如用色谱法分离。

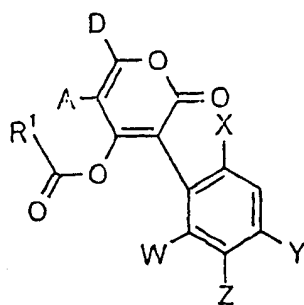
为简明起见，下文在每一种情况下只给出一种可能的异构体。这并不排除化合物如果适宜可以以异构体混合物或对应的另一种异构体形式存在。

包括基团 G 的各种含意(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)和(g)，如果 CKE 表示基团(5)，则产生下列主结构(I-5-a)至(I-5-g)，

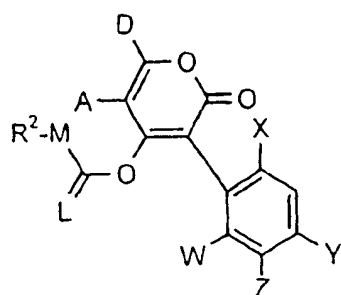
(I-5-a):



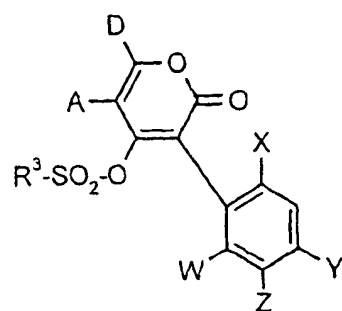
(I-5-b):



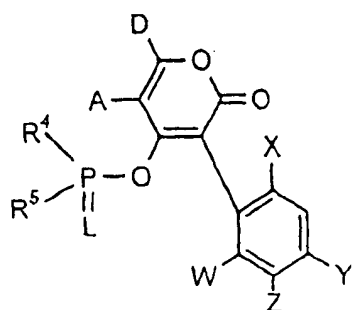
(I-5-c):



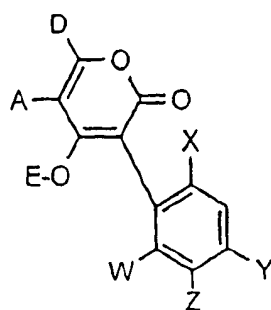
(I-5-d):



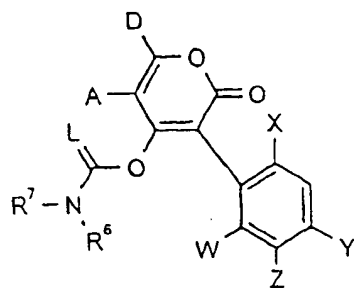
(I-5-e):



(I-5-f):



(I-5-g):

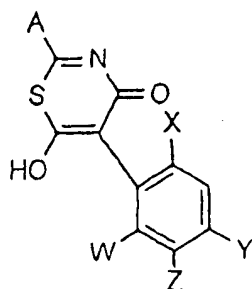


其中

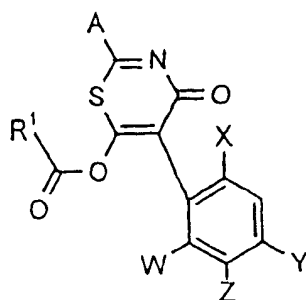
A、D、E、L、M、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和 R⁷ 各如上定义。

包括基团 G 的各种含意 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g)，
如果 CKE 表示基团 (6)，则产生下列主结构 (I-6-a) 至 (I-6-g)，

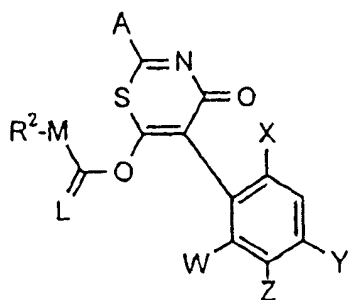
(I-6-a):



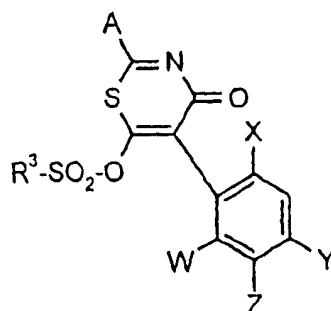
(I-6-b):



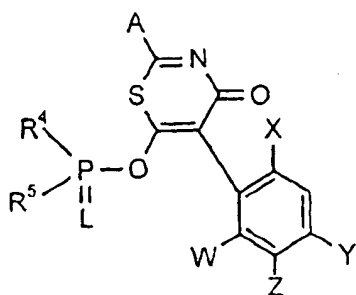
(I-6-c):



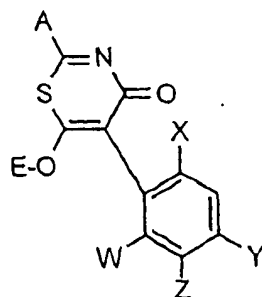
(I-6-d):



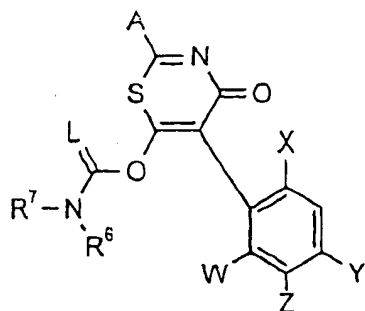
(I-6-e):



(I-6-f):



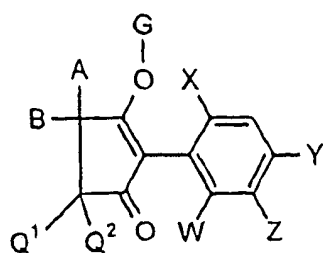
(I-6-g):



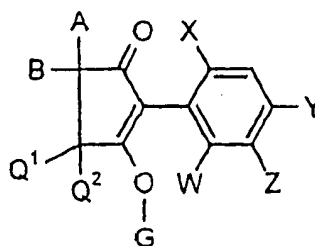
其中

A、E、L、M、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和R⁷各如上定义。

取决于取代基G的位置，式(I-7)化合物可以以式(I-7-A)和(I-7-B)这二种异构体形式存在，



(I-7-A)



(I-7-B)

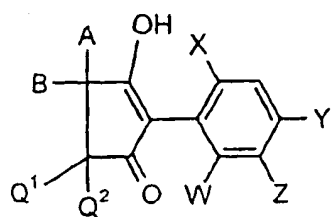
它将由式中(I-7)的虚线表示。

式(I-7-A)和(I-7-B)化合物可以以混合物或其纯异构体形式存在。式(I-7-A)和(I-7-B)化合物的混合物如果需要可以用本身已知的方式通过物理方法例如用色谱法分离。

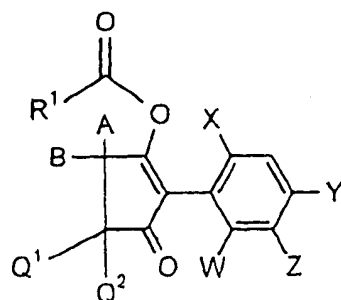
为简明起见，下文在每一种情况下只给出一种可能的异构体。这并不排除化合物如果适宜可以以异构体混合物或对应的另一种异构体形式存在。

包括基团G的各种含意(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)和(g)，产生下列主结构(I-7-a)至(I-7-g)，

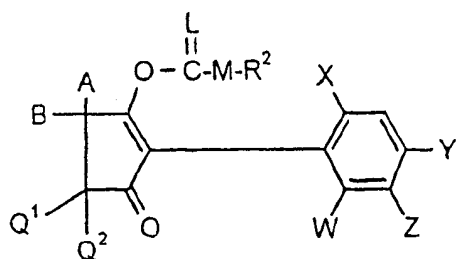
(I-7-a):



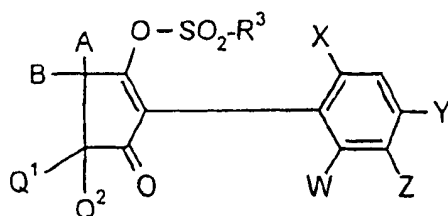
(I-7-b):



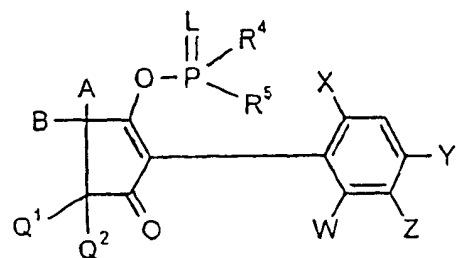
(I-7-c):



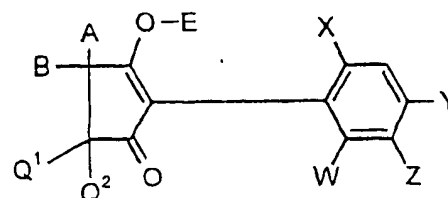
(I-7-d):



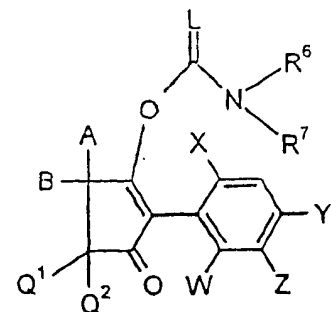
(I-7-e):



(I-7-f):



(I-7-g):

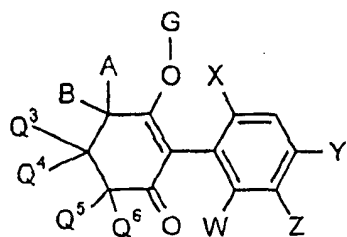


其中

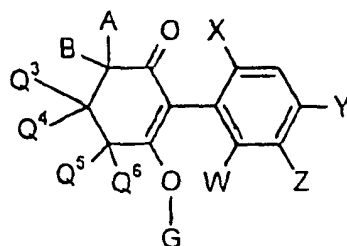
A、B、Q¹、Q²、E、L、M、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 和 R⁷

各如上定义。

取决于取代基 G 的位置，式 (I-8) 化合物可以以式 (I-8-A) 和 (I-8-B) 这二种异构体形式存在，



(I-8-A)



(I-8-B)

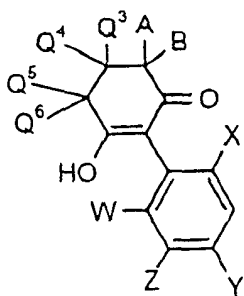
它将由式中 (I-8) 的虚线表示。

式 (I-8-A) 和 (I-8-B) 化合物可以以混合物或其纯异构体形式存在。式 (I-8-A) 和 (I-8-B) 化合物的混合物如果需要可以用本身已知的方式通过物理方法例如用色谱法分离。

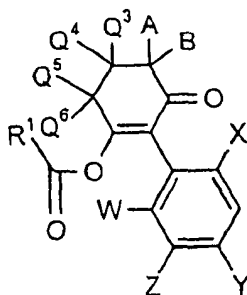
为简明起见，下文在每一种情况下只给出一种可能的异构体。这并不排除化合物如果适宜可以以异构体混合物或对应的另一种异构体形式存在。

包括基团 G 的各种含意 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g)，产生下列主结构 (I-8-a) 至 (I-8-g)，

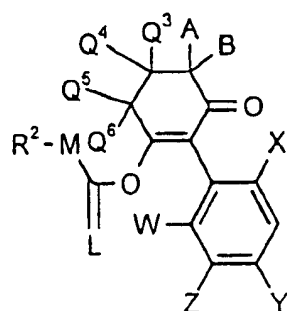
(I-8-a):



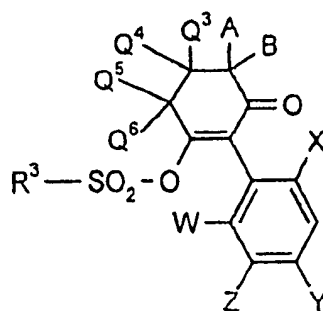
(I-8-b):



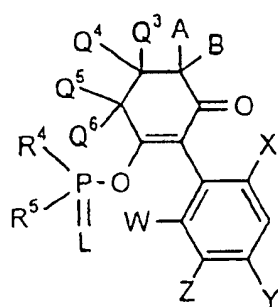
(I-8-c):



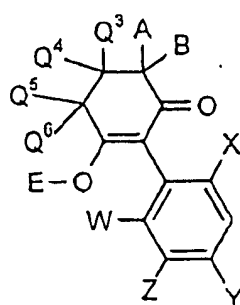
(I-8-d):



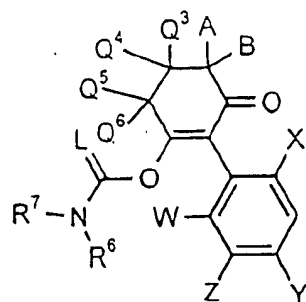
(I-8-e):



(I-8-f):



(I-8-g):

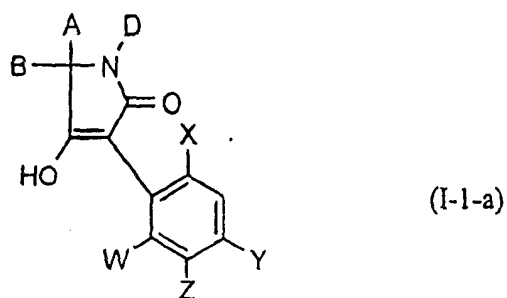


其中

A、B、E、L、M、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和R⁷各如上定义。

再者，业已发现，新的式(I)化合物通过如下方法之一获得：

(A) 式(I-1-a)的取代的3-苯基吡咯烷-2,4-二酮或其烯醇

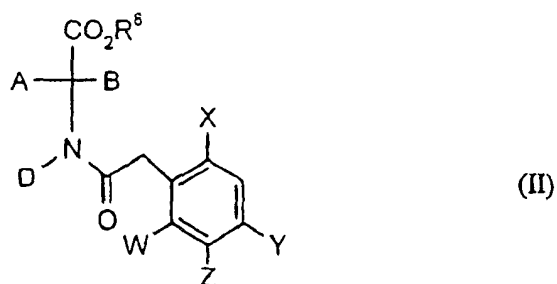


其中

A、B、D、W、X、Y和Z各如上定义，

如下获得：

将式(II)的N-酰基氨基酸酯



其中

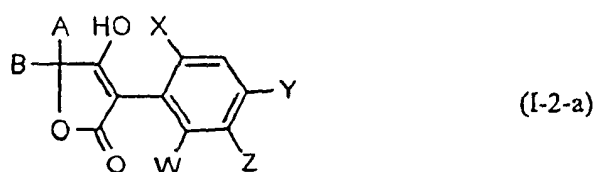
A、B、D、W、X、Y和Z各如上定义，

和

R^6 表示烷基(优选 C_1 - C_6 -烷基)，

在稀释剂存在下和在碱存在下进行分子内缩合。

(B) 此外，还发现，式(I-2-a)的取代的3-苯基-4-羟基- Δ^3 -二羟基呋喃酮衍生物

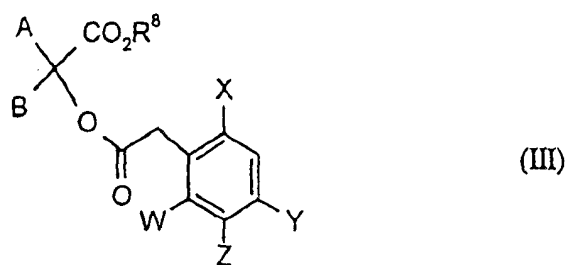


其中

A、B、W、X、Y和Z各如上定义，

如下获得：

将式(III)的羧酸酯

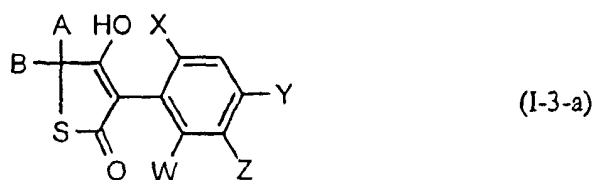


其中

A、B、W、X、Y、Z和R⁸各如上定义，

在稀释剂存在下和在碱存在下进行分子内缩合。

(C) 而且还发现，式(I-3-a)的取代的 3-苯基-4-羟基- Δ^3 -二羟基噻吩酮衍生物

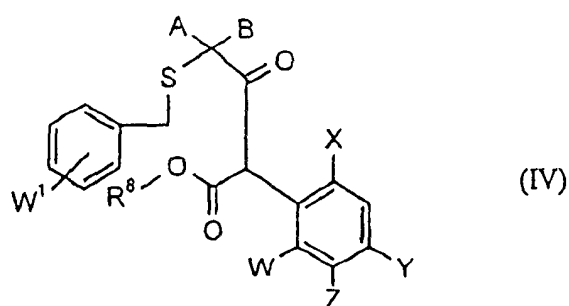


其中

A、B、W、X、Y和Z各如上定义，

如下获得：

将式(IV)的 β -酮羧酸酯



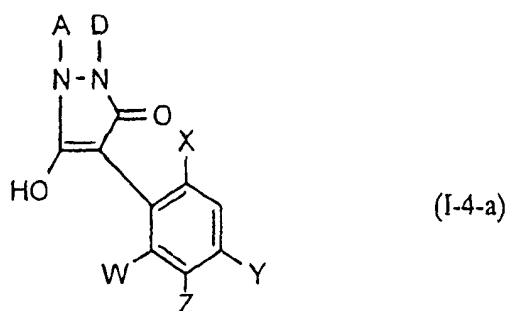
其中

A、B、W、X、Y、Z 和 R^8 各如上定义，且

W' 表示氢、卤素、烷基(优选 C_1-C_6 -烷基)或烷氧基(优选 C_1-C_6 -烷氧基)

如果适宜在稀释剂存在下和在酸存在下,进行分子内环化。

(D) 式(I-4-a)的 3-羟基-4-苯基-5-氧代-吡咯啉

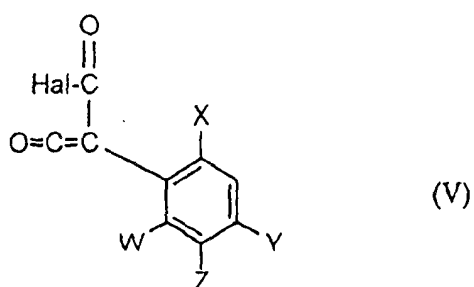


其中

A、D、W、X、Y 和 Z 各如上定义，

如下获得：

(α)使式(V)的卤代羰基烯酮



其中

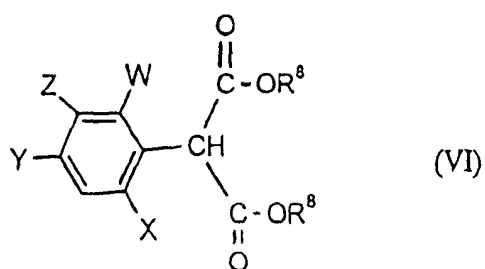
W、X、Y和Z各如上定义,

和

Hal 表示卤素(特别是氯或溴),

或

(β)使式(VI)的丙二酸衍生物



其中

R⁸、W、X、Y和Z各如上定义

与式(VII)的肼

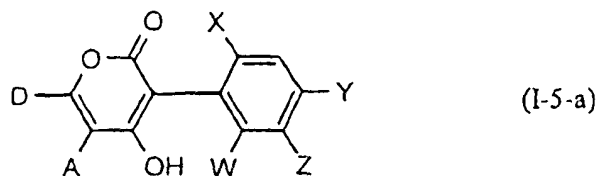


其中

A和D各如上定义

如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在碱存在下反应。

(E) 再者还发现, 新的式(I-5-a)的取代的3-苯基吡喃酮衍生物

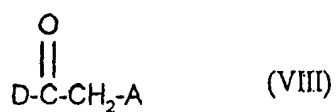


其中

A、D、W、X、Y和Z各如上定义,

如下获得:

使式(VIII)的羰基化合物



其中

A 和 D 各如上定义,

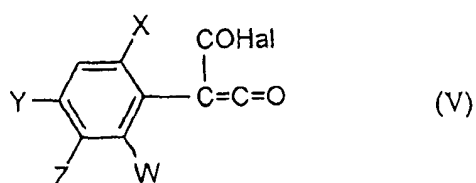
或式(VIIIa)的其甲硅烷基烯醇醚



其中

A、D 和 R^8 各如上定义,

与式(V)的烯酮酰基卤



其中

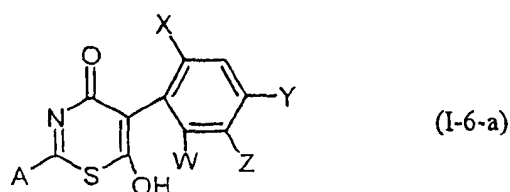
W、X、Y 和 Z 各如上定义, 和

Hal 表示卤素(优选表示氯或溴),

如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸受体存在下反应.

再者, 还发现

(F) 式(I-6-a)的新的取代的苯基-1,3-噻嗪衍生物



其中

A、W、X、Y和Z各如上定义，

如下获得：

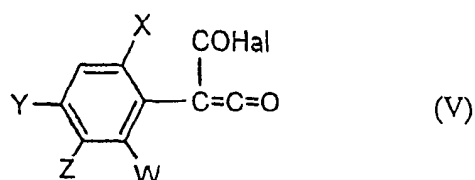
使式(IX)的硫代酰胺



其中

A如上定义，

与式(V)的烯酮酰基卤



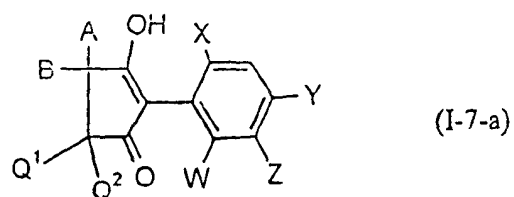
其中

Hal、W、X、Y和Z各如上定义，

如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸受体存在下反应。

再者，还发现

(G) 式(I-7-a)化合物

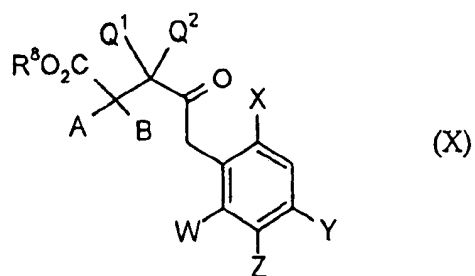


其中

A、B、Q¹、Q²、W、X、Y和Z各如上定义，

如下获得：

使式(X)的酮羧酸酯



其中

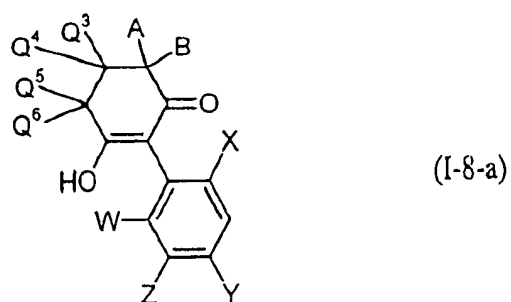
A、B、Q¹、Q²、W、X、Y和Z各如上定义，和

R⁸ 表示烷基(特别是 C₁-C₈-烷基)

如果适宜在稀释剂存在下和在碱存在下，进行分子内环化。

此外，还发现，

(H) 式(I-8-a)化合物

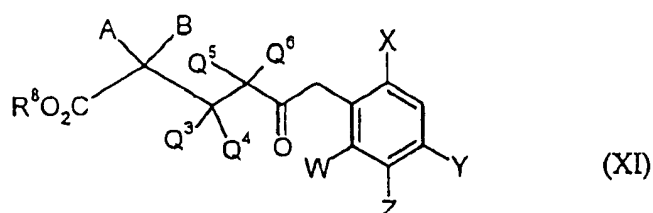


其中

A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y和Z如上定义，

如下获得：

使式(XI)的 6-芳基-5-酮基-乙酸酯



其中

A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y和Z各如上定义，

和

R⁸ 表示烷基(优选 C₁-C₆-烷基)

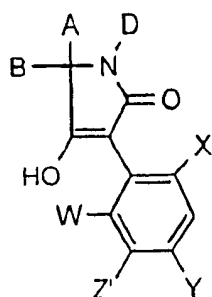
在稀释剂存在下和在碱存在下进行分子内缩合；

或

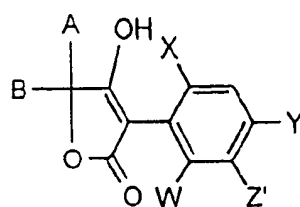
(I) 如上所示的式(I-1-a)至(I-8-a)化合物，其中A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y和Z各如上定义，如下获得

在溶剂、碱和催化剂存在下，适合的催化剂特别是钨配合物，使式(I-1'-a)至(I-8'-a)化合物

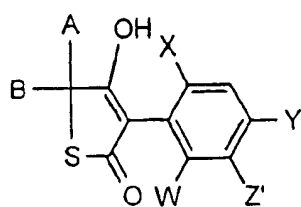
(I-1'-a):



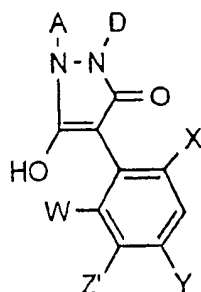
(I-2'-a):



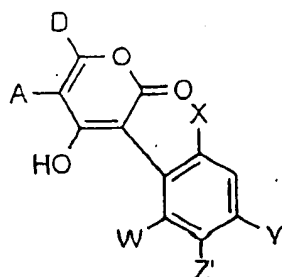
(I-3'-a):



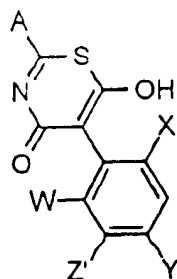
(I-4'-a):



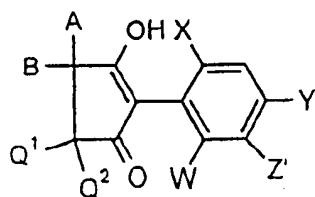
(I-5'-a):



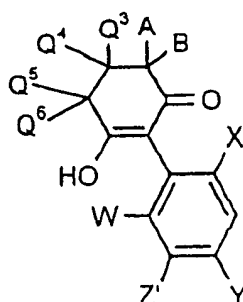
(I-6'-a):



(I-7'-a):



(I-8'-a):



其中

A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X和Y各如上定义，和
Z' 表示氯、溴或碘，优选表示溴，
与式(XII)的硼酸反应



其中

Z 如上定义。

还发现

(J) 如上所示的式(I-1-b)至(I-8-b)化合物，其中A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、R¹、W、X、Y和Z各如上定义，如下获得
如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下，使如上所示的式(I-1-a)至(I-8-a)化合物，其中A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y和Z各如上定义，在每一种情况下，
(α)与式(XIII)的酰基卤反应



其中

R¹ 如上定义，和

Hal 表示卤素(特别是氯或溴),

或

(β)与式(XIV)羧酸酐反应



其中

R^1 如上定义;

(K) 如上所示的式(I-1-c)至(I-8-c)化合物, 其中 A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 R^2 、M、W、X、Y和Z各如上定义且L表示氧, 如下获得

如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下, 使如上所示的式(I-1-a)至(I-8-a)化合物, 其中 A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、W、X、Y和Z各如上定义, 在每一种情况下, 与式(XV)的氯代甲酸酯或氯代甲酸硫酯反应



其中

R^2 和M 如上定义;

(L) 如上所示的式(I-1-c)至(I-8-c)化合物, 其中 A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 R^2 、M、W、X、Y和Z各如上定义且L表示硫, 如下获得

如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下, 使如上所示的式(I-1-a)至(I-8-a)化合物, 其中 A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、W、X、Y和Z各如上定义, 在每一种情况下, 与式(XVI)的氯代单硫代甲酸酯或氯代二硫代甲酸酯反应



其中

M 和 R² 如上定义;

(M) 如上所示的式 (I-1-d) 至 (I-8-d) 化合物, 其中 A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、R³、W、X、Y 和 Z 各如上定义, 如下获得

如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下, 使如上所示的式 (I-1-a) 至 (I-8-a) 化合物, 其中 A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y 和 Z 各如上定义, 在每一种情况下,

与式 (XVII) 的磺酰氯反应



其中

R³ 如上定义;

(N) 如上所示的式 (I-1-e) 至 (I-8-e) 化合物, 其中 A、B、D、L、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、R⁴、R⁵、W、X、Y 和 Z 各如上定义, 如下获得
如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下, 使如上所示的式 (I-1-a) 至 (I-8-a) 化合物, 其中 A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y 和 Z 各如上定义, 在每一种情况下,
与式 (XVIII) 的磷化合物反应



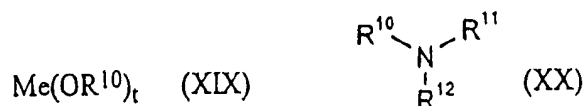
其中

L、R⁴ 和 R⁵ 如上定义, 和

Hal 表示卤素(特别氯或溴);

(O) 如上所示的式 (I-1-f) 至 (I-8-f) 化合物, 其中 A、B、D、E、

Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、W、X、Y和Z各如上定义，如下获得
 如果适宜在稀释剂存在下，使如上所示的式(I-1-a)至(I-8-a)化合物，其中A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、W、X、Y和Z各如上定义，
 在每一种情况下，
 与式(XIX)或(XX)的金属化合物或胺反应



其中

Me 表示单或二价金属(优选碱金属或碱土金属，如锂、钠、钾、镁或钙)，t 表示数字1或2，和

R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 相互独立地各表示氢或烷基(优选 C_1 - C_6 -烷基)，

(P) 如上所示的式(I-1-g)至(I-8-g)化合物，其中A、B、D、L、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 R^6 、 R^7 、W、X、Y和Z各如上定义，如下获得
 使如上所示的式(I-1-a)至(I-8-a)化合物，其中A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、W、X、Y和Z各如上定义，在每一种情况下，
 如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在催化剂存在下，
 (α)与式(XXI)的异氰酸酯或异硫氰酸酯反应



其中

R^6 和L 各如上定义，

或

如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下，

(β)与式(XXII)的氨基甲酰氯或硫代氨基甲酰氯反应



其中

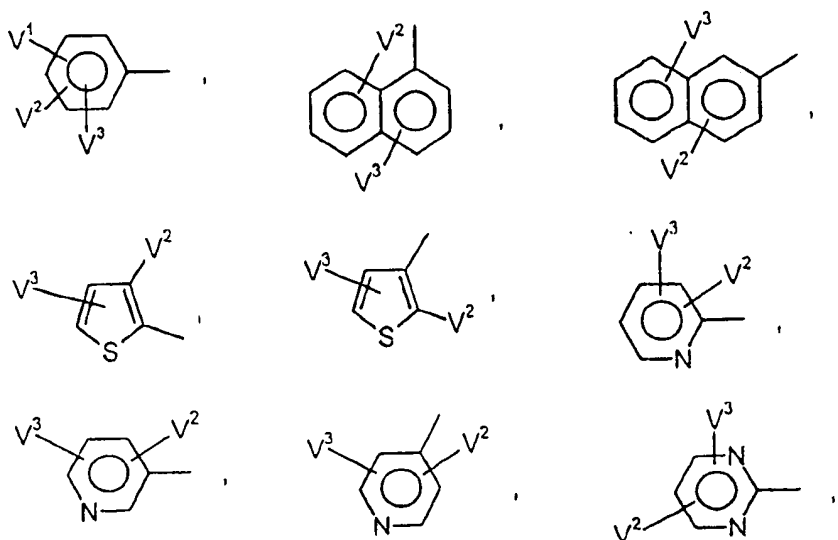
L、R⁶和 R⁷ 如上定义。

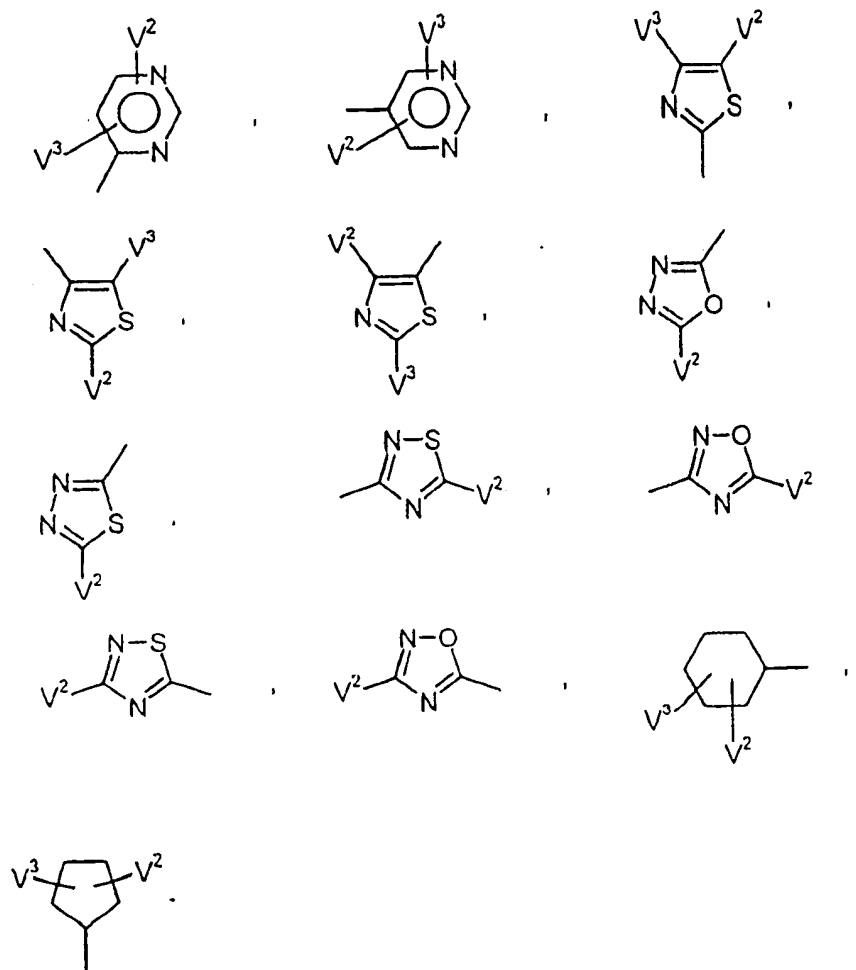
再者，业已发现，新的式(I)化合物作为农药具有非常好的活性，特别是作为杀虫剂、杀螨剂和作为除草剂。

式(I)提供本发明化合物的一般定义，在上下文中提到的各化学式中列出的基团的优选的取代基或范围说明如下：

X 优选表示卤素、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₃-C₆-链烯氧基、C₁-C₆-烷基硫基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₃-C₆-卤代链烯氧基、硝基、氰基或均任选由卤素-、C₁-C₆-烷基-、C₁-C₆-烷氧基-、C₁-C₄-卤代烷基-、C₁-C₄-卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的苯基、苯氧基、苯硫基、苄氧基或苄硫基。

Z 优选表示下列基团之一：



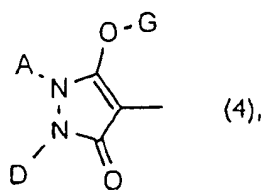
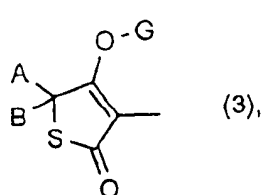
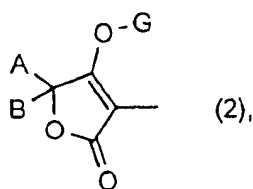
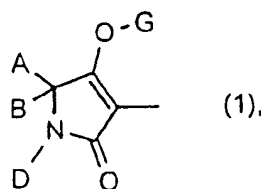
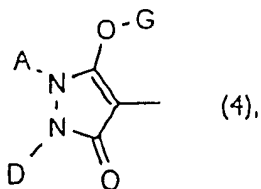
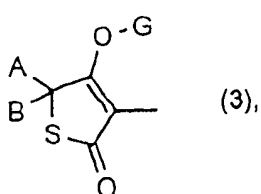
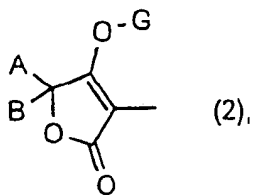
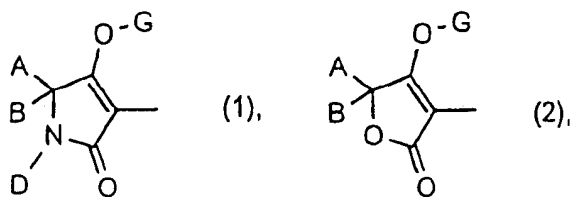


V^1 优选表示氢、卤素、 C_1 - C_{12} -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -烷硫基、 C_1 - C_6 -烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基、 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、硝基、氰基，或表示苯基、苯氧基、苯氧基- C_1 - C_4 -烷基、苯基- C_1 - C_4 -烷氧基、苯硫基- C_1 - C_4 -烷基或苯基- C_1 - C_4 -烷硫基，这些基团均任选由卤素、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、硝基或氰基单或多取代。

V^2 和 V^3 相互独立地各优选表示氢、卤素、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_4 -卤代烷基或 C_1 - C_4 -卤代烷氧基。

W 和 Y 相互独立地各优选表示氢、卤素、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -卤代烷氧基、硝基或氰基。

CKE 优选表示下列基团之一



A 优选表示氢或均任选由卤素取代的 C_1-C_{12} -烷基、 C_3-C_8 -链烯基、 C_1-C_{10} -烷氧基- C_1-C_8 -烷基、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基、 C_1-C_{10} -烷硫基- C_1-C_6 -烷基、任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-或 C_1-C_6 -烷氧基-取代的其中任选地一或二个不直接相邻的环成员由氧和/或硫替代的 C_3-C_8 -环烷基，或表示各任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -卤代烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基-、氟基-或硝基-取代的 C_6 -或 C_{10} -芳基(苯基或萘基)、具有 5 或 6 个环原子的杂芳基(例如呋喃基、吡啶基、咪唑基、三唑基、吡唑基、噻唑基、噻吩基)或 C_6 -或 C_{10} -芳基- C_1-C_6 -烷基(苯基- C_1-C_6 -烷基或萘基- C_1-C_6 -烷基)。

B 优选表示氢、 C_1-C_{12} -烷基或 C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基，或

A、B 和其连接的碳原子优选表示饱和 C_3-C_{10} -环烷基或不饱和 C_5-C_{10} -环烷基，其中任选地一个环成员由氧或硫替代，且它们任选由

C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_{10} -环烷基、 C_1-C_8 -卤代烷基、 C_1-C_8 -烷氧基、 C_1-C_8 -烷硫基、卤素或苯基单或二取代，或

A、B 和其连接的碳原子优选表示 C_3-C_6 -环烷基，该环烷基由一个任选地含有一或二个不直接相邻的氧和 / 或硫原子的亚烷基二基取代，或由亚烷二氧基或由亚烷二硫基取代，其与其所连接的碳原子一起形成另一个五-至八元环，或

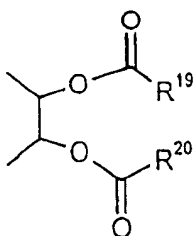
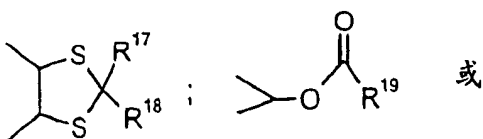
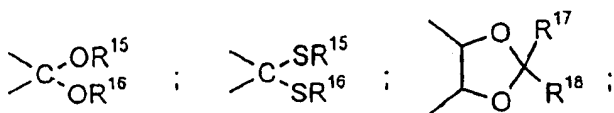
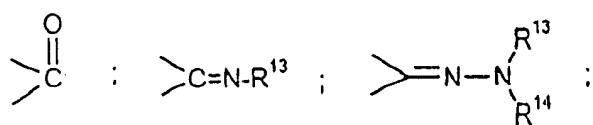
A、B 和其连接的碳原子优选表示 C_3-C_8 -环烷基或 C_5-C_8 -环烯基，其中二个取代基与它们连接的碳原子一起表示均任选由 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-或卤素-取代的 C_2-C_6 -烷二基、 C_2-C_6 -链烯二基或 C_4-C_6 -烷二烯二基，其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代。

D 优选表示氢，均任选由卤素-取代的 C_1-C_{12} -烷基、 C_3-C_8 -链烯基、 C_3-C_8 -炔基、 C_1-C_{10} -烷氧基- C_2-C_8 -烷基、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_2-C_8 -烷基、 C_1-C_{10} -烷硫基- C_2-C_8 -烷基、任选由卤素-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-或 C_1-C_4 -卤代烷基-取代的其中任选地一个环成员由氧和 / 或硫替代的 C_3-C_8 -环烷基，或表示各任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -卤代烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_6 -卤代烷氧基-、氰基-或硝基-取代的苯基、具有 5 或 6 个环原子的杂芳基(例如呋喃基、咪唑基、吡啶基、噻唑基、吡唑基、嘧啶基、吡咯基、噻吩基或三唑基)、苯基- C_1-C_6 -烷基或具有 5 或 6 个环原子的杂芳基- C_1-C_6 -烷基(例如呋喃基-、咪唑基-、吡啶基-、噻唑基-、吡唑基-、嘧啶基-、吡咯基-、噻吩基-或三唑基- C_1-C_6 -烷基)，或

A 和 D 一起优选表示均任选取代的 C_3-C_6 -烷二基或 C_3-C_6 -链烯二基，其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代，

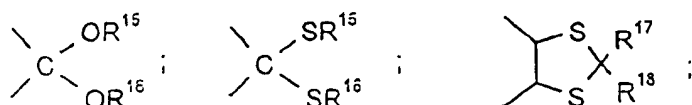
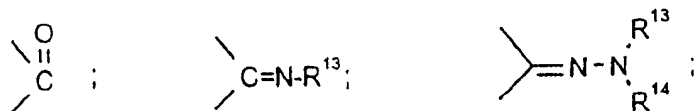
其中，可能的取代基各为：

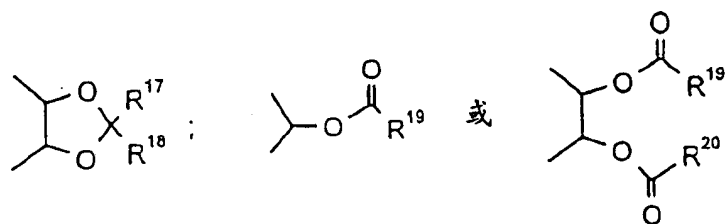
卤素、羟基、巯基或均任选由卤素-取代的 C_1-C_{10} -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷硫基、 C_3-C_7 -环烷基、苯基或苄氧基，或另一 C_3-C_6 -烷二基、 C_3-C_6 -链烯二基或丁二烯基，这些基团任选由 C_1-C_6 -烷基取代或其中任选地二个相邻的取代基与其连接的碳原子一起形成另一具有 5 或 6 个环原子的饱和或不饱和环(在式(I-1)化合物的情况下，A 和 D，与其连接的碳原子一起，表示，例如下文提到的基团 AD-1 至 AD-10)，该环可以含有氧或硫，或其中任选地含有下列基团之一：



或

A 和 Q¹ 一起优选表示 C₃-C₆-烷二基或 C₄-C₆-链烯二基, 它们各任选由相同或不同的选自下列的基团单或二取代: 卤素, 羟基, C₁-C₁₀-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷硫基、C₃-C₇-环烷基, 它们各任选由相同或不同的卤素单至三取代, 和苄氧基或苯基, 它们各任选由相同或不同的选自卤素、C₁-C₆-烷基或 C₁-C₆-烷氧基的基团单至三取代; 且所述 C₃-C₆-烷二基或 C₄-C₆-链烯二基还任选含有下列基团之一:





或由一个 C_1 - C_2 -烷二基或由氧原子桥接, 或

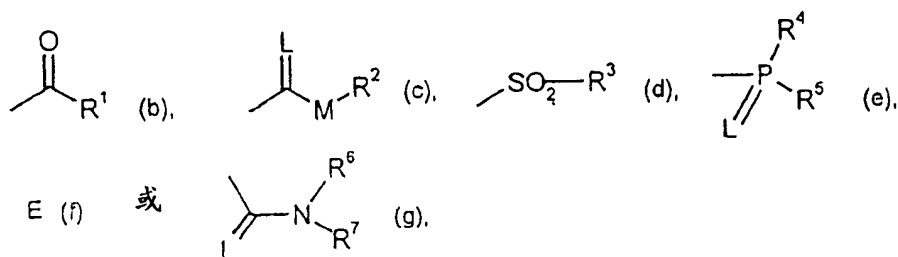
Q^1 优选表示氢或 C_1 - C_4 -烷基。

Q^2 、 Q^4 、 Q^5 和 Q^6 相互独立地各优选表示氢或 C_1 - C_4 -烷基。

Q^3 优选表示氢、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_2 -烷基、 C_1 - C_6 -烷硫基- C_1 - C_2 -烷基、任选由 C_1 - C_4 -烷基-或 C_1 - C_4 -烷氧基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3 - C_8 -环烷基或任选由卤素-、 C_1 - C_4 -烷基-、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_2 -卤代烷基-、 C_1 - C_2 -卤代烷氧基-、氟基-或硝基-取代的苯基, 或

Q^3 和 Q^4 与其连接的碳原子一起优选表示一个任选由 C_1 - C_4 -烷基-、 C_1 - C_4 -烷氧基-或 C_1 - C_2 -卤代烷基-取代的其中任选地一个环成员由氧或硫替代的 C_3 - C_7 -环。

G 优选表示氢(a)或表示下列基团之一:



特别是(a)、(b)或(c)

其中

E 表示金属离子或铵离子,

L 表示氧或硫, 和

M 表示氧或硫。

R^1 优选表示均可任选由卤素-取代的 C_1 - C_{20} -烷基、 C_2 - C_{20} -链烯基、 C_1 - C_8 -烷氧基- C_1 - C_8 -烷基、 C_1 - C_8 -烷硫基- C_1 - C_8 -烷基、多- C_1 - C_8 -

烷氧基- C_1-C_8 -烷基、任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-或 C_1-C_6 -烷氧基-取代的其中任选一或多个（优选不多于两个）不直接相邻的环成员由氧和/或硫替代的 C_3-C_8 -环烷基，

表示任选由卤素-、氰基-、硝基-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_6 -卤代烷基-、 C_1-C_6 -卤代烷氧基-、 C_1-C_6 -烷硫基-或 C_1-C_6 -烷基磺酰基-取代的苯基，

表示任选由卤素-、氰基-、硝基-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_6 -卤代烷基-或 C_1-C_6 -卤代烷氧基-取代的苯基- C_1-C_6 -烷基，

表示任选由卤素-或 C_1-C_6 -烷基-取代的 5 或 6 元的杂芳基（例如吡唑基、噻唑基、吡啶基、嘧啶基、咪唑基或噻吩基），

表示任选由卤素-或 C_1-C_6 -烷基-取代的苯氧基- C_1-C_6 -烷基，或

表示任选由卤素-、氰基-或 C_1-C_6 -烷基取代的 5-或 6-元杂芳氧基- C_1-C_6 -烷基（例如，吡啶氧基- C_1-C_6 -烷基、嘧啶氧基- C_1-C_6 -烷基或噻唑氧基- C_1-C_6 -烷基）。

R^2 优选表示均可任选由卤素-取代的 C_1-C_{20} -烷基、 C_2-C_{2n} -链烯基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_2-C_8 -烷基、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_2-C_8 -烷基，

表示任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-或 C_1-C_6 -烷氧基-取代的 C_3-C_8 -环烷基，或

表示均可任选由卤素-、氰基-、硝基-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_6 -卤代烷基-或 C_1-C_6 -卤代烷氧基-取代的苯基或苄基。

R^3 优选表示任选由卤素-取代的 C_1-C_8 -烷基，或表示均可任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_4 -卤代烷基-、 C_1-C_4 -卤代烷氧基-、氰基-或硝基-取代的苯基或苄基。

R^4 和 R^5 相互独立地各优选表示均可任选由卤素-取代的 C_1-C_8 -烷基、 C_1-C_8 -烷氧基、 C_1-C_8 -烷基氨基、二- $(C_1-C_8$ -烷基)氨基、 C_1-C_8 -烷硫基、 C_2-C_8 -链烯硫基、 C_3-C_7 -环烷基硫基，或表示均可任选由卤素-、氰基-、硝基-、 C_1-C_4 -烷氧基-、 C_1-C_4 -卤代烷氧基-、 C_1-C_4 -烷硫基-、 C_1-C_4 -卤代烷硫基-、 C_1-C_4 -烷基-或 C_1-C_4 -卤代烷基-取代的苯基、苯氧基或苯硫基。

R^6 和 R^7 相互独立地各优选表示氢，表示均可任选由卤素-取代的 C_1-C_8 -烷基、 C_3-C_8 -环烷基、 C_1-C_8 -烷氧基、 C_3-C_8 -链烯基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基，表示任选由卤素-、 C_1-C_8 -卤代烷基-、 C_1-C_8 -烷基-或

C_1-C_8 -烷氧基-取代的苯基, 任选由卤素-、 C_1-C_8 -烷基-、 C_1-C_8 -卤代烷基-或 C_1-C_8 -烷氧基-取代的苄基或一起表示一个任选由 C_1-C_4 -烷基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3-C_8 -亚烷基。

R^{13} 优选表示氢, 表示均可任选由卤素-取代的 C_1-C_8 -烷基或 C_1-C_8 -烷氧基, 表示任选由卤素-、 C_1-C_4 -烷基-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3-C_8 -环烷基, 或表示均可任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_4 -卤代烷基-、 C_1-C_4 -卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的苯基、苯基- C_1-C_4 -烷基或苯基- C_1-C_4 -烷氧基。

R^{14} 优选表示氢或 C_1-C_8 -烷基或

R^{13} 和 R^{14} 一起优选表示 C_4-C_8 -烷二基。

R^{15} 和 R^{16} 相同或不同且优选表示 C_1-C_6 -烷基, 或

R^{15} 和 R^{16} 一起优选表示 C_2-C_4 -烷二基, 它任选由 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基或由任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_4 -卤代烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_4 -卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的苯基取代。

R^{17} 和 R^{18} 相互独立地优选表示氢, 表示任选由卤素-取代的 C_1-C_8 -烷基, 或表示任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_4 -卤代烷基-、 C_1-C_4 -卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的苯基, 或

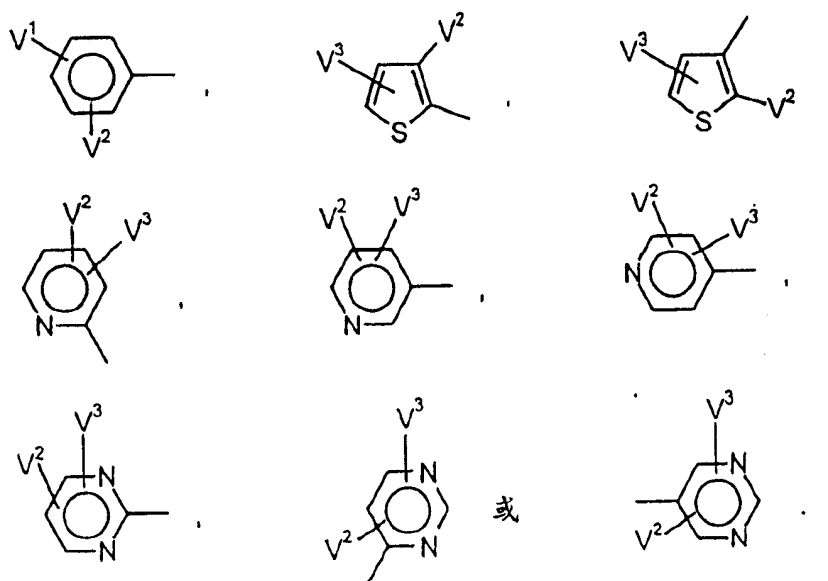
R^{17} 和 R^{18} 与其连接的碳原子一起优选表示一个羰基, 或表示任选由卤素-、 C_1-C_4 -烷基-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_5-C_7 -环烷基。

R^{19} 和 R^{20} 相互独立地各优选表示 C_1-C_{10} -烷基、 C_2-C_{10} -链烯基、 C_1-C_{10} -烷氧基、 C_1-C_{10} -烷基氨基、 C_3-C_{10} -链烯氨基、二- $(C_1-C_{10}$ -烷基)氨基或二- $(C_3-C_{10}$ -链烯基)氨基。

在优选的定义中, 卤素表示氟、氯、溴和碘, 且特别是表示氟、氯和溴。

X 特别优选表示氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_3-C_4 -链烯氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_4 -卤代链烯氧基、硝基或氰基。

Z 特别优选表示下列基团之一:

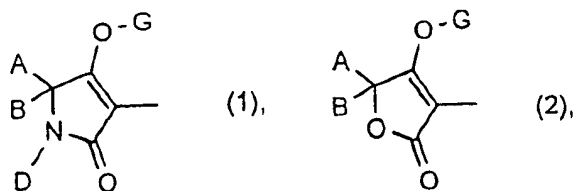


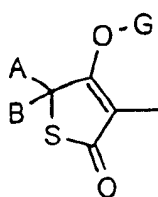
V^1 特别优选表示氢、氟、氯、溴、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_2 -卤代烷基、 C_1-C_2 -卤代烷氧基、硝基、氰基，或表示苯基、苯氧基、苯氧基- C_1-C_2 -烷基、苯基- C_1-C_2 -烷氧基、苯硫基- C_1-C_2 -烷基或苯基- C_1-C_2 -烷硫基，这些基团各任选由氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_2 -卤代烷基、 C_1-C_2 -卤代烷氧基、硝基或氰基单或二取代。

V^2 和 V^3 相互独立地各特别优选表示氢、氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_2 -卤代烷基或 C_1-C_2 -卤代烷氧基。

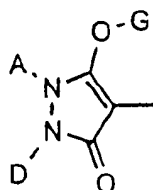
W 和 Y 相互独立地各特别优选表示氢、氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -卤代烷氧基。

CKE 特别优选表示下列基团之一：

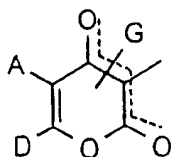




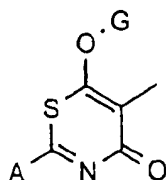
(3),



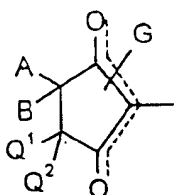
(4),



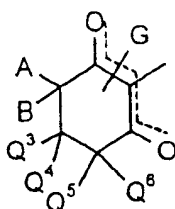
(5),



(6),



(7),



(8).

A 特别优选表示氢, 或表示均可任选由氟-或氯-取代的 C_1-C_{10} -烷基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基、任选由氟-、氯-、 C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的其中任选地一个环成员由氧或硫替代的 C_3-C_7 -环烷基或(但不在式(I-5)、(I-7)和(I-8)的情况下)均可任选由氟-、氯-、溴-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -卤代烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-或 C_1-C_4 -卤代烷氧基-取代的苯基、呋喃基、吡啶基、咪唑基、三唑基、吡唑基、噻啶基、噻唑基、噻吩基或苯基- C_1-C_4 -烷基。

B 特别优选表示氢或 C_1-C_6 -烷基, 或

A、B 和其连接的碳原子特别优选表示饱和或不饱和的 C_5-C_7 -环烷基, 其中任选地一个环成员由氧或硫替代且其任选由 C_1-C_6 -烷基、 C_5-C_8 -环烷基、 C_1-C_3 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、氟、氯或苯基单取代, 或

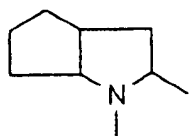
A、B 和其连接的碳原子特别优选表示 C_5-C_6 -环烷基, 它由一个任选地含有一或二个不直接相邻的氧或硫原子的亚烷基二基或由亚烷二氧基或由亚烷二硫基取代的, 这些基团与其连接的碳原子一起形成另一个五或六个环, 或

A、B 和其连接的碳原子特别优选表示 C_3 - C_6 -环烷基或 C_5 - C_6 -环烯基，其中二个取代基与其连接的碳原子一起表示均可任选由 C_1 - C_5 -烷基-、 C_1 - C_5 -烷氧基-、氟-、氯-或溴-取代的 C_2 - C_4 -烷二基或 C_2 - C_4 -链烯二基，其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代，或表示丁二烯二基。

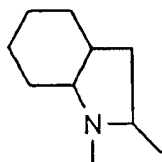
D 特别优选表示氢，或表示均可任选由氟-或氯-取代的 C_1 - C_{10} -烷基、 C_3 - C_6 -链烯基、 C_1 - C_8 -烷氧基- C_2 - C_6 -烷基或 C_1 - C_8 -烷硫基- C_2 - C_6 -烷基，表示任选由氟-、氯-、 C_1 - C_4 -烷基-、 C_1 - C_4 -烷氧基-或 C_1 - C_2 -卤代烷基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3 - C_7 -环烷基或(但不在式(I-1)和(I-4)化合物的情况下)表示均可任选由氟-、氯-、溴-、 C_1 - C_4 -烷基-、 C_1 - C_4 -卤代烷基-、 C_1 - C_4 -烷氧基-或 C_1 - C_4 -卤代烷氧基-取代的苯基、呋喃基、咪唑基、吡啶基、噻唑基、吡唑基、嘧啶基、吡咯基、噻吩基、三唑基或苯基- C_1 - C_4 -烷基，或

A 和 D 一起特别优选表示任选取代的 C_3 - C_5 -烷二基，其中一个亚甲基可以由一个羰基、氧或硫替代，可能的取代基为羟基、 C_1 - C_6 -烷基或 C_1 - C_4 -烷氧基，或

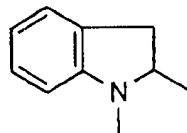
A 和 D(在式(I-1)的情况下)与其连接的原子一起特别优选表示基团 AD-1 至 AD-10 之一：



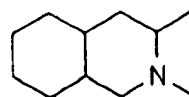
AD-1



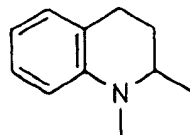
AD-2



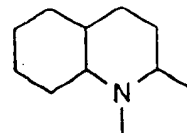
AD-3



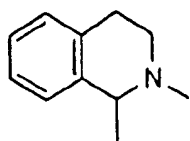
AD-4



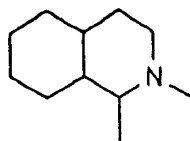
AD-5



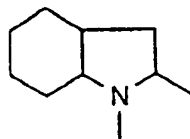
AD-6



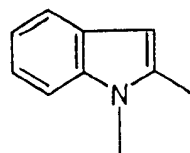
AD-7



AD-8



AD-9



AD-10

或者

A 和 Q^1 一起特别优选表示 C_3 - C_4 -烷二基或 C_3 - C_4 -链烯二基, 它们各任选由相同或不同的选自下列的基团单或二取代: 氟、氯、羟基和各任选由氟单至三取代的 C_1 - C_8 -烷基和 C_1 - C_4 -烷氧基, 或

Q^1 特别优选表示氢。

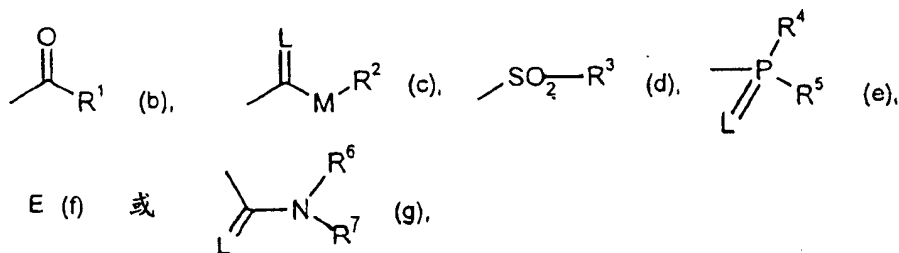
Q^2 特别优选表示氢。

Q^4 、 Q^5 和 Q^6 相互独立地各特别优选表示氢或 C_1 - C_3 -烷基。

Q^3 特别优选表示氢、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_2 -烷基、 C_1 - C_4 -烷硫基- C_1 - C_2 -烷基或任选由甲基-或甲氧基-取代的, 其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3 - C_6 -环烷基, 或

Q^3 和 Q^4 与其连接的碳原子一起特别优选表示一个任选由 C_1 - C_4 -烷基-或 C_1 - C_4 -烷氧基-取代的饱和的其中任选地一个环成员由氧或硫替代的 C_5 - C_6 -环。

G 特别优选表示氢 (a) 或特别优选表示下列基团之一:



特别是表示(a)、(b)或(c),

其中

E 表示金属离子或铵离子,

L 表示氧或硫, 和

M 表示氧或硫.

R¹ 特别优选表示均可任选由氟-或氯-取代的 C₁-C₁₆-烷基、C₂-C₁₆-链烯基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷硫基-C₁-C₆-烷基、多-C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基或任选由氟-、氯-、C₁-C₅-烷基或 C₁-C₅-烷氧基-取代的其中任选地一或二个不直接相连的环成员由氧和/或硫替代的 C₃-C₇-环烷基,

表示任选由氟-、氯-、溴-、氟基-、硝基-、C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-烷氧基-、C₁-C₃-卤代烷基-、C₁-C₃-卤代烷氧基-、C₁-C₄-烷硫基-或 C₁-C₄-烷基磺酰基-取代的苯基,

表示任选由氟-、氯-、溴-、C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-烷氧基-、C₁-C₃-卤代烷基-或 C₁-C₃-卤代烷氧基-取代的苯基-C₁-C₄-烷基,

表示均可任选由氟-、氯-、溴-或 C₁-C₄-烷基-取代的吡唑基、噻唑基、吡啶基、嘧啶基、呋喃基或噻吩基,

表示任选由氟-、氯-、溴-或 C₁-C₄-取代的苯氧基-C₁-C₃-烷基,
或

表示均可任选由氟-、氯-、溴-、氨基-或 C₁-C₄-烷基-取代的吡啶氧基-C₁-C₃-烷基、嘧啶氧基-C₁-C₃-烷基或噻唑氧基-C₁-C₃-烷基.

R² 特别优选表示均可任选由氟-取代的 C₁-C₁₆-烷基、C₂-C₁₆-链烯基、C₁-C₆-烷氧基-C₂-C₆-烷基或多-C₁-C₆-烷氧基-C₂-C₆-烷基,

表示任选由氟-、氯-、C₁-C₄-烷基-或 C₁-C₄-烷氧基-取代的 C₃-C₇-环烷基, 或

表示均可任选由氟-、氯-、溴-、氟基-、硝基-、C₁-C₄-烷基-、C₁-C₃-烷氧基-、C₁-C₃-卤代烷基-或 C₁-C₃-卤代烷氧基-取代的苯基或苄基.

R³ 特别优选表示任选由氟-取代的 C₁-C₆-烷基, 或特别优选表示均可任选由氟-、氯-、溴-、C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-烷氧基-、C₁-C₃-卤代烷基-、C₁-C₃-卤代烷氧基-、氟基-或硝基-取代的苯基或苄基.

R⁴ 和 R⁶ 相互独立地各特别优选表示 C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、

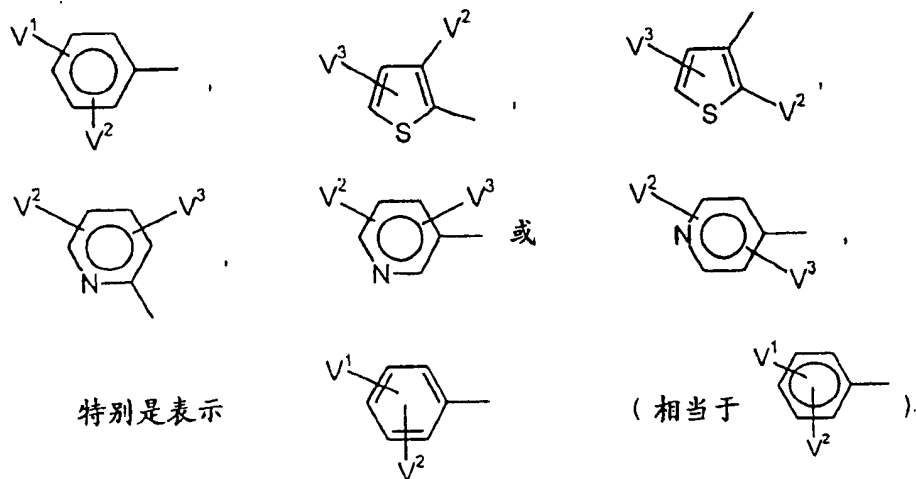
C_1-C_6 -烷基氨基、二- $(C_1-C_6$ -烷基)氨基、 C_1-C_6 -烷硫基、 C_3-C_4 -链烯硫基、 C_3-C_6 -环烷基硫基，或表示均可任选由氟-、氯-、溴-、硝基-、氰基-、 C_1-C_3 -烷氧基-、 C_1-C_3 -卤代烷氧基-、 C_1-C_3 -烷硫基-、 C_1-C_3 -卤代烷硫基-、 C_1-C_3 -烷基-或 C_1-C_3 -卤代烷基-取代的苯基、苯氧基或苯硫基。

R^6 和 R^7 相互独立地各特别优选表示氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_3-C_6 -链烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基，表示任选由氟-、氯-、溴-、 C_1-C_3 -卤代烷基-、 C_1-C_4 -烷基-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的苯基，表示任选由氟-、氯-、溴-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_3 -卤代烷基-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的苄基，或一起表示一个任选由甲基-或乙基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_4-C_6 -亚烷基。

在特别优选的基团定义中，卤素表示氟、氯、溴和碘，特别是表示氟、氯和溴。

X 非常特别优选表示氟、氯、甲基、乙基、丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、三氟甲基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、硝基或氰基。

Z 非常特别优选表示下列基团之一：

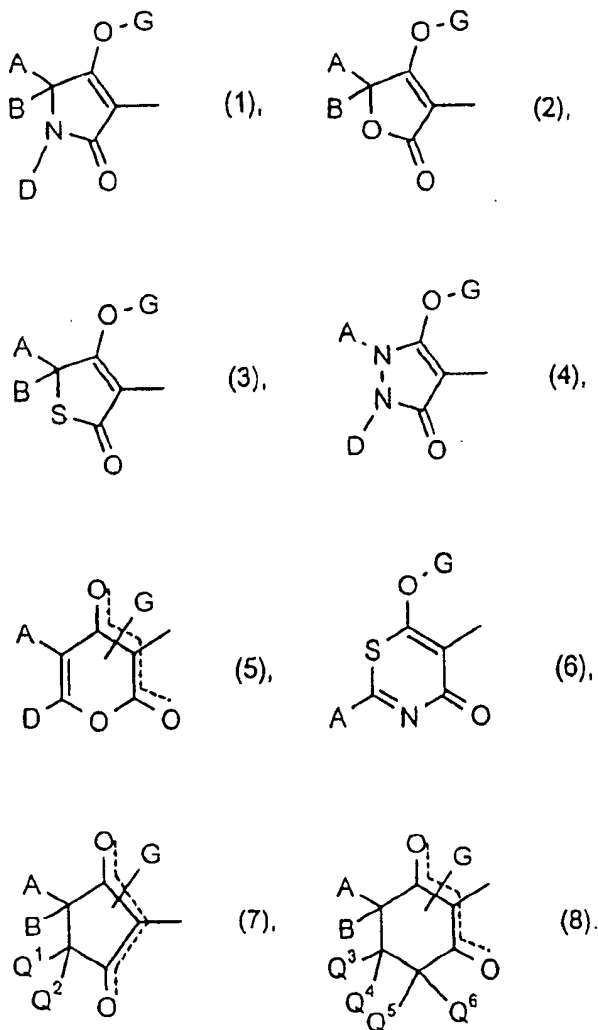


V^1 非常特别优选表示氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、硝基、氰基或任选由氟、氯、甲基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基单取代的苯基。

V^2 和 V^3 相互独立地各非常特别优选表示氢、氟、氯、甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、三氟甲基或三氟甲氧基。

W 和 Y 相互独立地各非常特别优选表示氢、氟、氯、甲基、乙基、正丙基、甲氧基、乙氧基或丙氧基。

CKE 非常特别优选表示下列基团之一：



A 非常特别优选表示氢，或表示各任选由氟-取代的 C_1-C_8 -烷基或 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、任选由氟-、甲基-、乙基-或甲氧基-取代的其中任选地一个环成员由氧或硫替代的 C_3-C_6 -环烷基或(但不在式(I-5)、(I-7)和(I-8)化合物的情况下)表示均可任选由氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-、甲氧基-、乙氧基-、三氟甲基-、三氟甲氧基-、氰基-或硝基-取代的苯基或苄基。

B 非常特别优选表示氢或 C_1-C_4 -烷基, 或

A、B 与其连接的碳原子一起非常特别优选表示饱和的 C_5-C_6 -环烷基, 其中任选地一个环成员由氧或硫替代且其任选由甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、氟或氯取代, 或

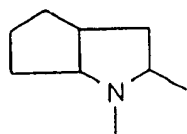
A、B 与其连接的碳原子一起非常特别优选表示 C_5-C_6 -环烷基或 C_5-C_6 -环烯基, 其中二个取代基与其连接的碳原子一起表示其中各任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_2-C_4 -烷二基或 C_2-C_4 -链烯二基, 或表示丁二烯二基。

D 非常特别优选表示氢, 表示均可任选由氟-或氯-取代的 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_4 -链烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_2-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷硫基- C_2-C_4 -烷基或其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3-C_6 -环烷基或(但在式(I-1)和(I-4)化合物的情况下)表示均可任选由氟-、氯-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-、甲氧基-、乙氧基-、三氟甲基-或三氟甲氧基-取代的苯基、呋喃基、吡啶基、噻吩基或苄基,

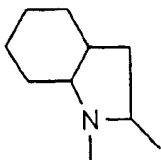
或

A 和 D 一起非常特别优选表示任选取代的 C_3-C_4 -烷二基, 其中任选地一个碳原子由硫替代且它任选由羟基、甲基、乙基、甲氧基或乙氧基取代, 或

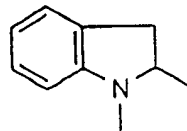
A 和 D(在式(I-1)化合物的情况下)与其连接的原子一起表示下列基团 AD 之一:



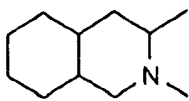
AD-1



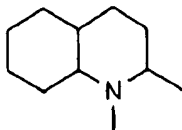
AD-2



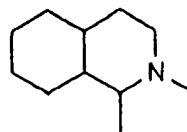
AD-3



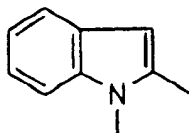
AD-4



AD-6



AD-8



AD-10

A 和 Q^1 非常特别优选表示任选由氟、羟基、甲基或甲氧基单-或二取代的 C_3 - C_4 -烷二基或丁烯二基, 或

Q^1 非常特别优选表示氢。

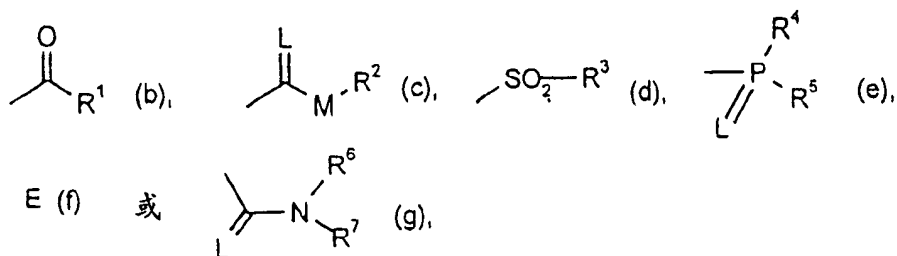
Q^2 非常特别优选表示氢。

Q^4 、 Q^5 和 Q^6 相互独立地非常特别优选表示氢、甲基或乙基。

Q^3 非常特别优选表示氢、甲基、乙基或其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3 - C_6 -环烷基, 或

Q^3 和 Q^4 与其连接的碳原子一起非常特别优选表示一个任选地由甲基-或甲氧基-取代的其中任选地一个环成员由氧或硫替代的饱和的 C_5 - C_6 -环。

G 非常特别优选表示氢(a)或表示下列基团之一:



特别是(a)、(b)或(c),

其中

E 表示金属离子或铵离子,

L 表示氧或硫, 和

M 表示氧或硫。

R¹ 非常特别优选表示均可任选由氟-或氯-取代的 C₁-C₁₄-烷基、C₂-C₁₄-链烯基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₆-烷基、多-C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基或任选由氟-、氯-、甲基-、乙基-、丙基-、异丙基-、丁基-、异丁基-、叔丁基-、甲氧基-、乙氧基-、正丙氧基-或异丙氧基-取代的 C₃-C₆-环烷基, 该环烷基中任选地一或二个不直接相邻的环成员由氧和/或硫替代,

表示任选氟-、氯-、溴-、氟基-、硝基-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-、甲氧基-、乙氧基-、三氟甲基-、三氟甲氧基-、甲硫基-、乙硫基-、甲基磺酰基-或乙基磺酰基-取代的苯基,

表示任选氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-、甲氧基-、乙氧基-、三氟甲基-或三氟甲氧基-取代的苄基,

表示均可任选由氟-、氯-、溴-、甲基-或乙基-取代的呋喃基、噻吩基、吡啶基、嘧啶基、噻唑基或吡唑基,

表示任选由氟-、氯-、甲基-或乙基-取代的苯氧基-C₁-C₂-烷基, 或

表示均可任选由氟-、氯-、氨基-、甲基-或乙基-取代的吡啶氧基-C₁-C₂-烷基、嘧啶氧基-C₁-C₂-烷基或噻唑氧基-C₁-C₂-烷基。

R² 非常特别优选表示均可任选由氟-取代的 C₁-C₁₄-烷基、C₂-C₁₄-链烯基、C₁-C₄-烷氧基-C₂-C₆-烷基或多-C₁-C₄-烷氧基-C₂-C₆-烷基,

表示任选由氟-、氯-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-或甲氧基-取代的 C₃-C₆-环烷基,

或表示均可任选由氟-、氯-、氟基-、硝基-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-、甲氧基-、乙氧基-、三氟甲基-或三氟甲氧基-取代的苯基或苄基。

R³ 非常特别优选表示均可任选由氟-取代的甲基、乙基、正丙基、异丙基或均可任选由氟-、氯-、溴-、甲基-、叔丁基-、甲氧基-、三氟甲基-、三氟甲氧基-、氟基-或硝基-取代的苯基或苄基。

R⁴ 和 R⁵ 相互独立地各非常特别优选表示 C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基氨基、二-(C₁-C₄-烷基)氨基、C₁-C₄-烷硫基, 或表示均可任选由氟-、氯-、溴-、硝基-、氟基-、C₁-C₂-烷氧基-、C₁-C₂-

氟代烷氧基-、 C_1 - C_2 -烷硫基-、 C_1 - C_2 -氟代烷硫基-或 C_1 - C_3 -烷基-取代的苯基、苯氧基或苯硫基。

R^6 和 R^7 相互独立地各非常特别优选表示氢，表示 C_1 - C_4 -烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_3 - C_4 -链烯基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基，表示任选由氟-、氯-、溴-、三氟甲基-、甲基-或甲氧基-取代的苯基，表示任选由氟-、氯-、溴-、甲基-、三氟甲基-或甲氧基-取代的苄基，或一起表示其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_5 - C_6 -亚烷基。

上面提到的一般或优选的基团定义或说明可以按需要相互组合，即，包括各自范围和优选范围间的组合。它们适合于终产物且因此适合于前体或中间体。

本发明优选的是含有上文列出的优选含意组合的式(I)化合物。

本发明特别优选的是含有上文列出的特别优选含意组合的式(I)化合物。

本发明非常特别优选的是含有上文列出的非常特别优选含意组合的式(I)化合物。

饱和或不饱和烃基如烷基或链烯基，在每一种情况下，也包括与杂原子的组合，例如烷氧基中，均可以是其可能的直链或支链。

除非另有说明，任选取代的基团可以是单或多取代，且在多取代的情况下，取代基可以相同或不同。

除了制备实施例中的化合物外，可以特别提到下列式(I-1-a)化合物

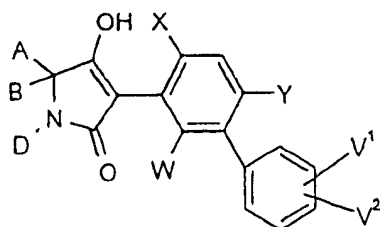


表 1: $W = H$; $X = CH_3$; $Y = H$, $V^1 = H$, $V^2 = H$.

A	B	D
CH_3	H	H
C_2H_5	H	H
C_3H_7	H	H
i- C_3H_7	H	H
C_4H_9	H	H
i- C_4H_9	H	H
s- C_4H_9	H	H
t- C_4H_9	H	H
CH_3	CH_3	H
C_2H_5	CH_3	H
C_3H_7	CH_3	H
i- C_3H_7	CH_3	H

表1 (续):

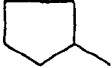
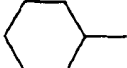
A	B	D
C_4H_9	CH_3	H
i- C_4H_9	CH_3	H
s- C_4H_9	CH_3	H
t- C_4H_9	CH_3	H
C_2H_5	C_2H_5	H
C_3H_7	C_3H_7	H
	CH_3	H
	CH_3	H
	CH_3	H
$-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_4-$		H
$-(CH_2)_5-$		H
$-(CH_2)_6-$		H
$-(CH_2)_7-$		H
$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H
$-CH_2-O-(CH_2)_3-$		H
$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$		H
$-CH_2-CHCH_3-(CH_2)_3-$		H
$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHC_2H_5-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHC_3H_7-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$		H

表1 (续):

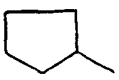
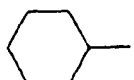
A	D	B
	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
	$-(\text{CH}_2)_4-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-\text{CH}_2-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-\text{CHCH}_3-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{S}-(\text{CH}_2)_2-$	H
	$-(\text{CH}_2)_2-\text{S}-\text{CH}_2-$	H
	$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---CH---} \\ \qquad \qquad \\ \text{---(CH}_2)_3\text{---} \end{array}$	H
H	CH_3	H
H	C_2H_5	H
H	C_3H_7	H
H	$i\text{-C}_3\text{H}_7$	H
H		H
H		H
H		H
CH_3	CH_3	H
CH_3	C_2H_5	H
CH_3	C_3H_7	H
CH_3	$i\text{-C}_3\text{H}_7$	H
CH_3		H

表 1 (续):

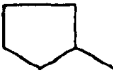
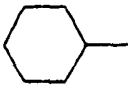
A	D	B
CH ₃		H
CH ₃		H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H

表 2: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

W = H; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = H; V² = H.

表 3: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

W = CH₃; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = H; V² = H.

表 4: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

W = H; X = CH₃; Y = H; V¹ = 4-Cl; V² = H.

表 5: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

W = H; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 4-Cl; V² = H.

表 6: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

W = CH₃; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 4-Cl; V² = H.

表 7: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

W = H; X = CH₃; Y = H; V¹ = 3-Cl; V² = H.

表 8: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

W = H; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 3-Cl; V² = H.

表 9: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

W = CH₃; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 3-Cl; V² = H.

表 10: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

W = H; X = CH₃; Y = H; V¹ = 2-Cl; V² = 4-Cl.

表 11: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

W = H; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 2-Cl; V² = 4-Cl.

表 12: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

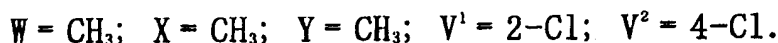


表 13: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

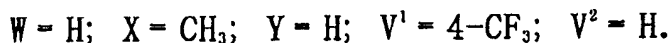


表 14: A、B 和 D 各如表 1 中所给出



表 15: A、B 和 D 各如表 1 中所给出



表 16: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

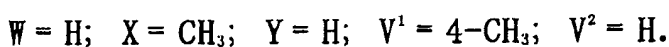


表 17: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

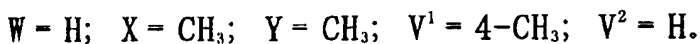


表 18: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

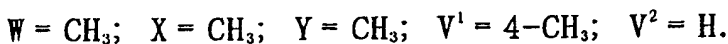


表 19: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

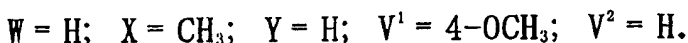


表 20: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

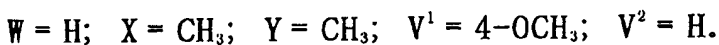
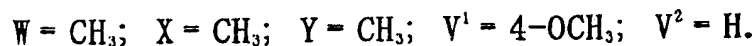


表 21: A、B 和 D 各如表 1 中所给出



除了制备实施例中的化合物外, 可以特别提到下列式 (I-2-a) 化合物

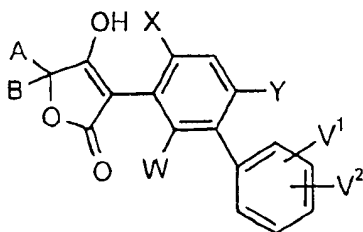


表 22: $W = H$; $X = CH_3$, $Y = H$, $V^1 = H$, $V^2 = H$.

A	B
CH_3	H
C_2H_5	H
C_3H_7	H
i- C_3H_7	H
C_4H_9	H
i- C_4H_9	H
s- C_4H_9	H
t- C_4H_9	H

表 22 (续):

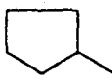
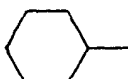
A	B
CH_3	CH_3
C_2H_5	CH_3
C_3H_7	CH_3
i- C_3H_7	CH_3
C_4H_9	CH_3
i- C_4H_9	CH_3
s- C_4H_9	CH_3
t- C_4H_9	CH_3
C_2H_5	C_2H_5
C_3H_7	C_3H_7
	CH_3
	CH_3
	CH_3
-(CH_2) ₂ -	
-(CH_2) ₄ -	
-(CH_2) ₅ -	
-(CH_2) ₆ -	
-(CH_2) ₇ -	
-(CH_2) ₂ -O-(CH_2) ₂ -	
-CH ₂ -O-(CH_2) ₃ -	
-(CH_2) ₂ -S-(CH_2) ₂ -	
-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH_2) ₃ -	
-(CH_2) ₂ -CHCH ₃ -(CH_2) ₂ -	

表 22 (续):

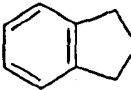
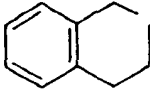
A	B
	$(\text{CH}_2)_2\text{-CHC}_2\text{H}_5\text{-(CH}_2)_2\text{-}$
	$\text{-(CH}_2)_2\text{-CHC}_3\text{H}_7\text{-(CH}_2)_2\text{-}$
	$\text{-(CH}_2)_2\text{-CHi-C}_3\text{H}_7\text{-(CH}_2)_2\text{-}$
	$\text{-(CH}_2)_2\text{-CHOCH}_3\text{-(CH}_2)_2\text{-}$
	$\text{-(CH}_2)_2\text{-CHOC}_2\text{H}_5\text{-(CH}_2)_2\text{-}$
	$\text{-(CH}_2)_2\text{-CHOC}_3\text{H}_7\text{-(CH}_2)_2\text{-}$
	$\text{-(CH}_2)_2\text{-CHi-C}_3\text{H}_7\text{-(CH}_2)_2\text{-}$
	$\text{-(CH}_2)_2\text{-C(CH}_3)_2\text{-(CH}_2)_2\text{-}$
	$\text{-CH}_2\text{-(CHCH}_3)_2\text{-(CH}_2)_2\text{-}$
	$\begin{array}{c} \text{—CH}_2\text{—CH—(CH}_2)_2\text{—CH—} \\ \qquad \qquad \\ \text{CH}_2 \end{array}$
	$\begin{array}{c} \text{—CH}_2\text{—CH—CH—CH}_2\text{—} \\ \qquad \qquad \\ \text{(CH}_2)_4 \end{array}$
	$\begin{array}{c} \text{—CH}_2\text{—CH—CH—(CH}_2)_2\text{—} \\ \qquad \qquad \\ \text{(CH}_2)_3 \end{array}$
	
	

表 23: A 和 B 各如表 22 所给出

$W = H; X = \text{CH}_3; Y = \text{CH}_3; V^1 = H; V^2 = H.$

表 24: A 和 B 各如表 22 所给出

$W = \text{CH}_3; X = \text{CH}_3; Y = \text{CH}_3; V^1 = H; V^2 = H.$

表 25: A 和 B 各如表 22 所给出

$W = H; X = \text{CH}_3; Y = H; V^1 = 4\text{-Cl}; V^2 = H.$

表 26: A 和 B 各如表 22 所给出



表 27: A 和 B 各如表 22 所给出

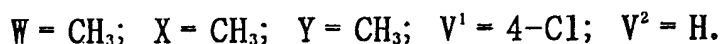


表 28: A 和 B 各如表 22 所给出

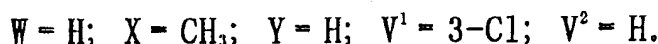


表 29: A 和 B 各如表 22 所给出



表 30: A 和 B 各如表 22 所给出

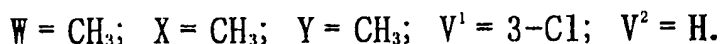


表 31: A 和 B 各如表 22 所给出

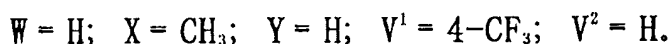


表 32: A 和 B 各如表 22 所给出



表 33: A 和 B 各如表 22 所给出



表 34: A 和 B 各如表 22 所给出



表 35: A 和 B 各如表 22 所给出

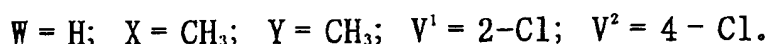


表 36: A 和 B 各如表 22 所给出

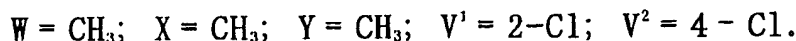


表 37: A 和 B 各如表 22 所给出

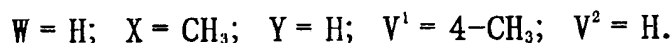


表 38: A 和 B 各如表 22 所给出



表 39: A 和 B 各如表 22 所给出

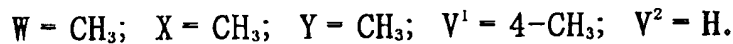


表 40: A 和 B 各如表 22 所给出

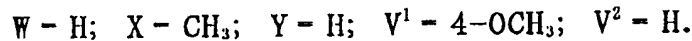


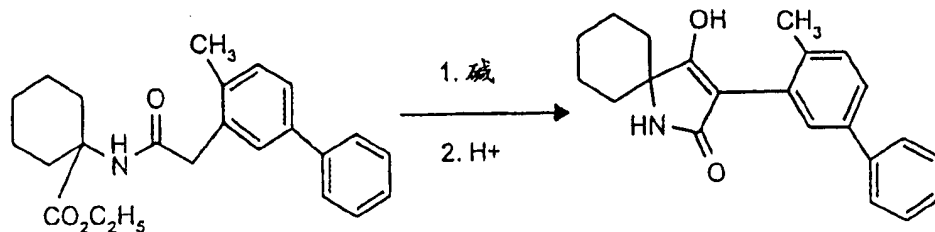
表 41: A 和 B 各如表 22 所给出



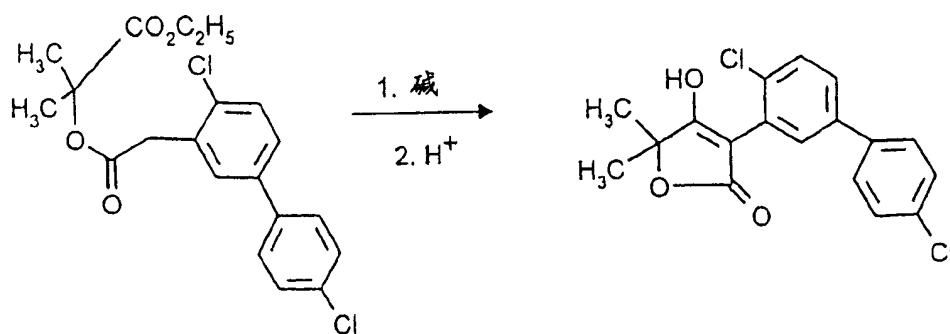
表 42: A 和 B 各如表 22 所给出

$W = CH_3$; $X = CH_3$; $Y = CH_3$; $V^1 = 4-OCH_3$; $V^2 = H$.

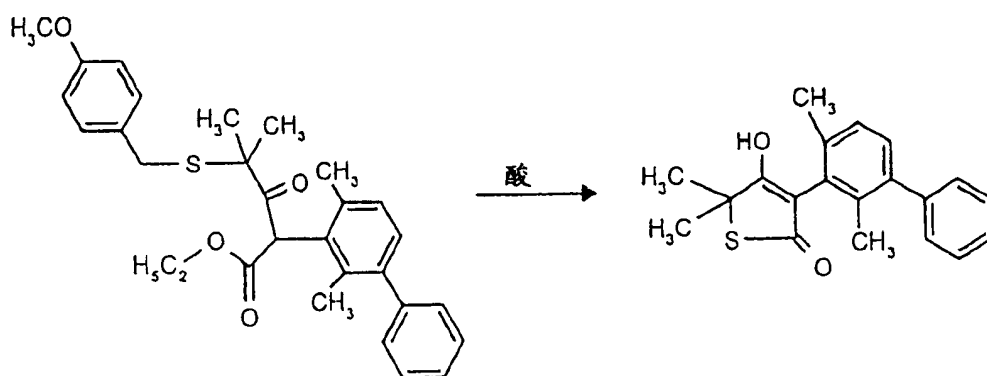
根据方法 (A), 使用例如 N-[(6-甲基-3-苯基)-苯基乙酰基]-1-氨基-环己基-羧酸乙酯作为起始原料, 本发明方法之途径可以由下列反应式来表示:



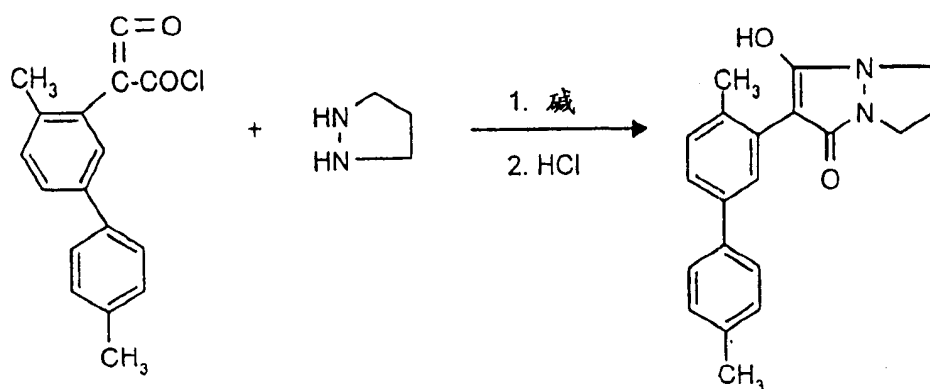
根据方法 (B), 使用例如 O-[(2-氯-5-(4-氯)-苯基)-苯基乙酰基]-2-羟基异丁酸乙酯 (B), 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



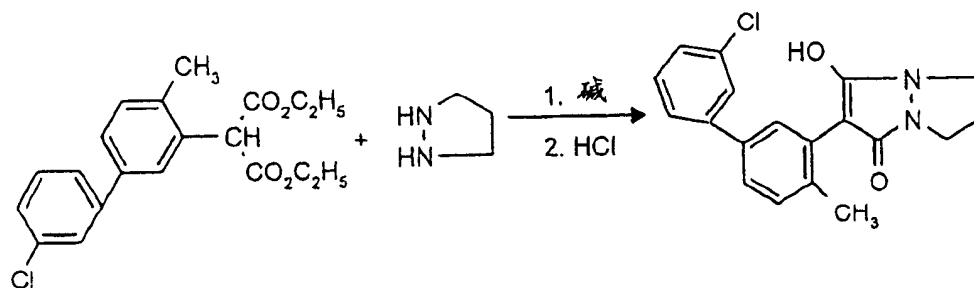
根据方法 (C), 使用例如 2-[(2,6-二甲基-3-苯基)-苯基]-4-(4-甲氧基)-苯基巯基-4-甲基-3-氧代-戊酸乙酯, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



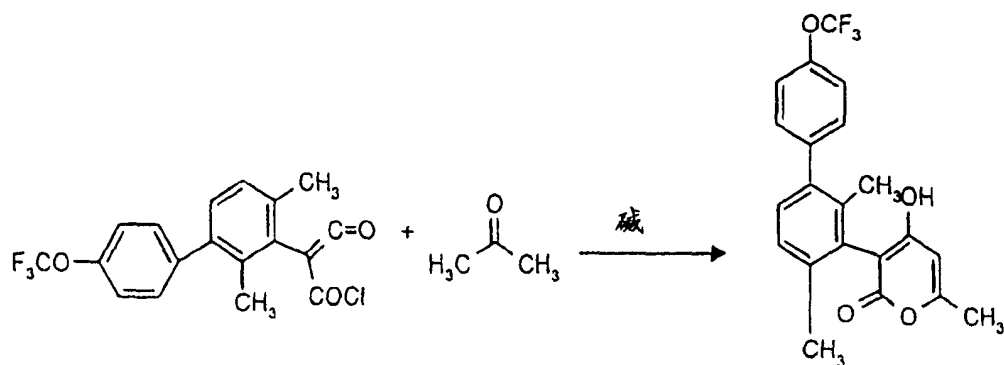
根据方法(D- α), 使用例如氯羧基 3-[(6-甲基-3-(4-甲基)-苯基)-苯基]烯酮和 1,2-二氮杂环戊烷作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



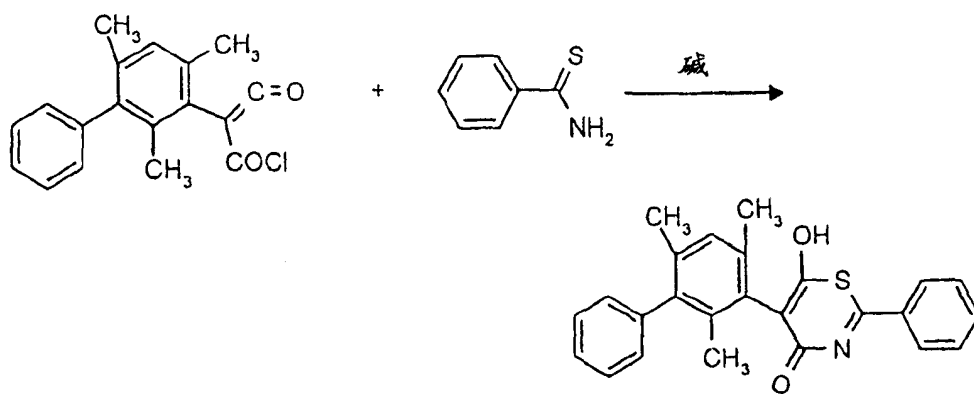
根据方法(D- β), 使用例如 3-[6-甲基-3-(3-氯-苯基)]-苯基丙二酸二乙酯和 1,2-二氮杂环戊烷作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



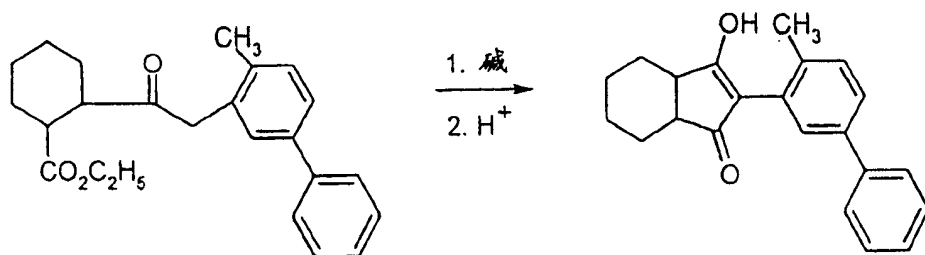
根据方法(E), 使用例如 2-[(2,6-二甲基-3-(4-三氟甲氧基-苯基))-苯基]烯酮和丙酮作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



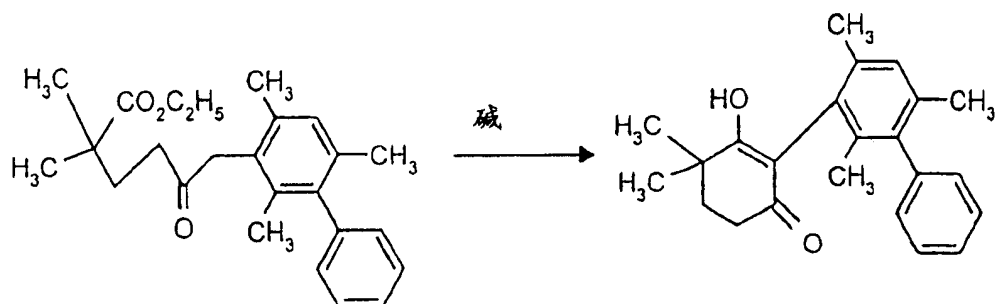
根据方法(F), 使用例如氯羰基 2-[(2,4,6-三甲基-3-苯基)-苯基]-烯酮和硫代苯甲酰胺作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



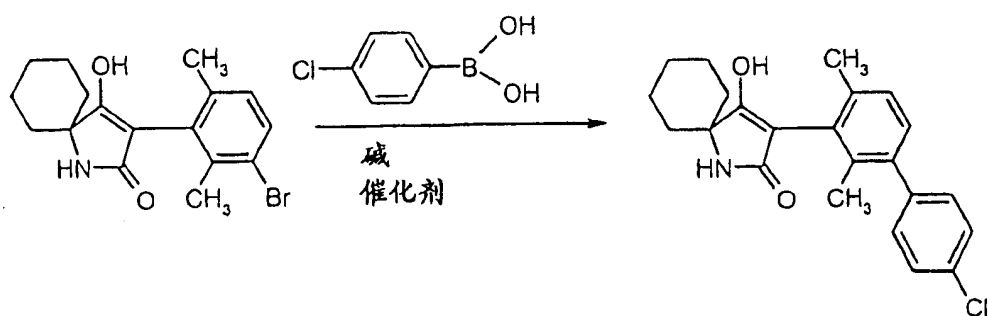
根据方法(G), 使用 5-[(6-甲基-3-苯基)-苯基]-2,3-四亚甲基-4-氧代-戊酸乙酯, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



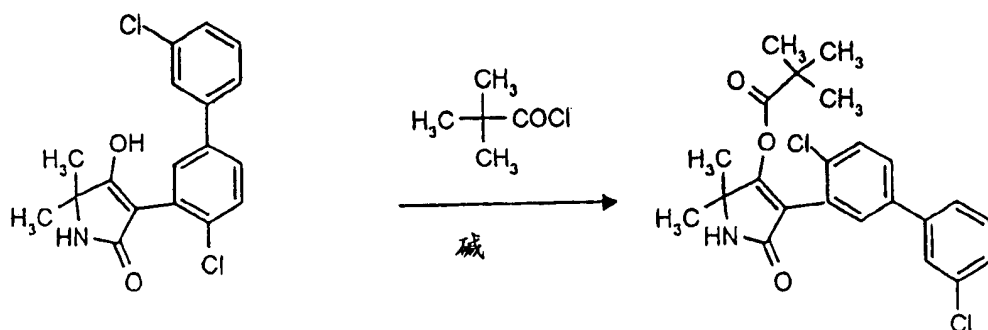
根据方法(H), 使用 5-[(2,4,6-三甲基-3-苯基)-苯基]-2,2-二甲基-5-氧代-己酸乙酯, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



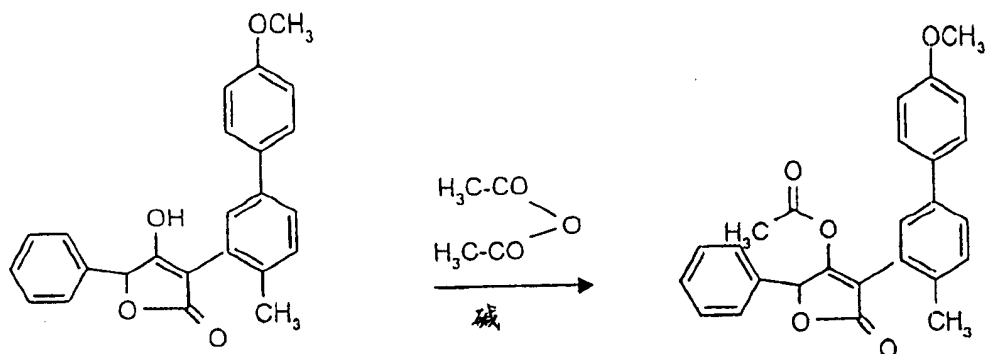
根据方法(I), 使用 3-[(2,6-二甲基-3-溴)-苯基]-4,4-(五亚甲基)-吡咯烷-2,4-二酮和 4-氯苯基硼酸作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



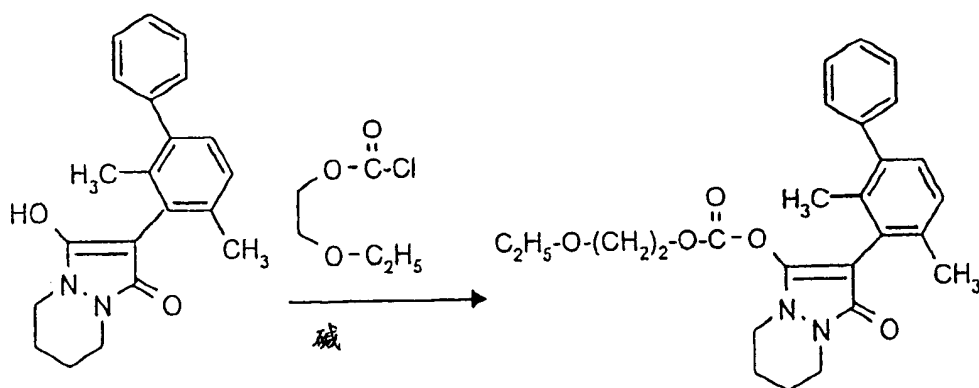
根据方法(J α), 使用 3-[(2-氯-5-(3-氯-苯基))-苯基]-5,5-二甲基吡咯烷-2,4-二酮和新戊酰氯作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



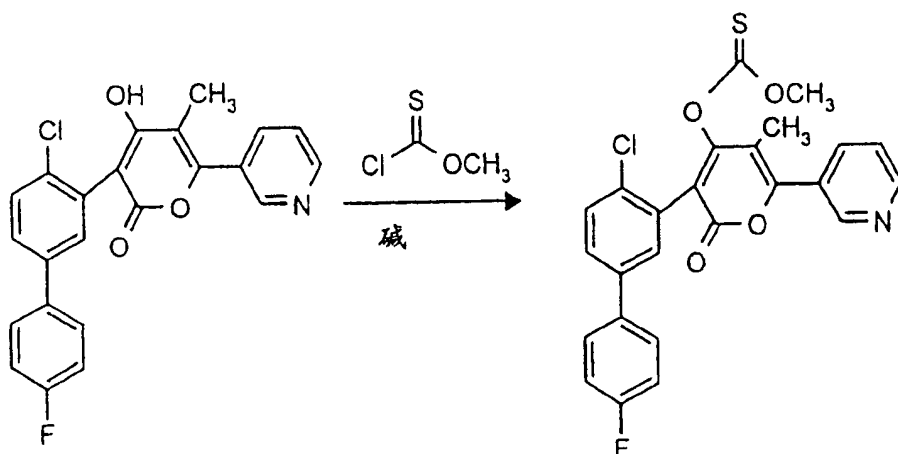
根据方法(J), (方案β), 使用 3-[(6-甲基-3-(4-甲氧基-苯基))-苯基]-4-羟基-5-苯基- Δ^3 -二氢吡喃-2-酮和乙酸酐作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



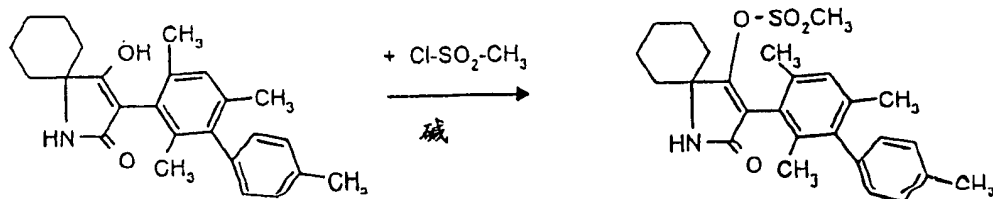
根据方法(K), 使用 8-[(2,6-二甲基-3-苯基)-苯基]-1,6-二氮杂-双环-(4.3.0^{1',6'})-壬烷-7,9-二酮和氯甲酸乙氧基乙基酯作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



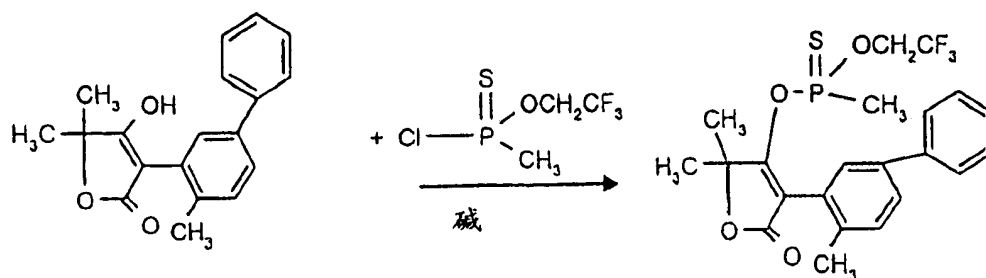
根据方法(L), 使用 3-[(2-氯-5-(4-氯-苯基)-苯基)-4-羟基-5-甲基-6-(3-吡啶基)-吡喃酮和氯单硫代甲酸甲酯作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



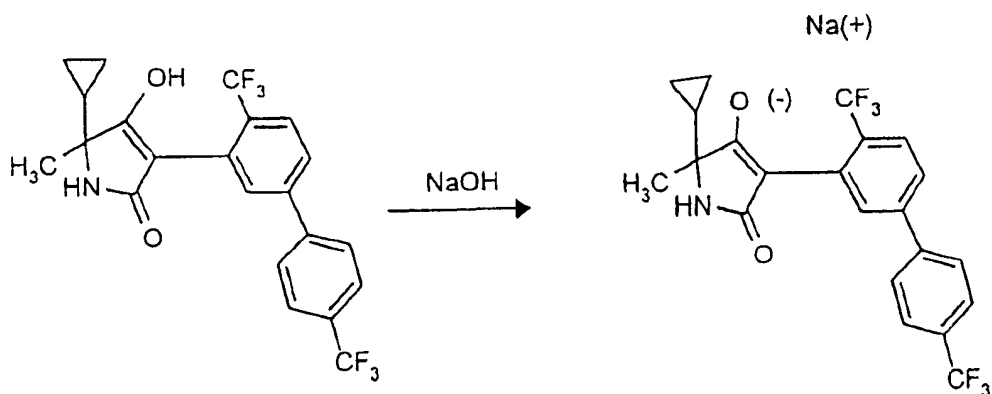
根据方法(M)，使用 2-[(2, 4, 6-三甲基-3-(4-甲基-苯基))-苯基]-5, 5-五亚甲基-吡咯烷-2, 4-二酮和甲磺酰氯作为起始原料，本发明方法之途径可以用下列反应式表示：



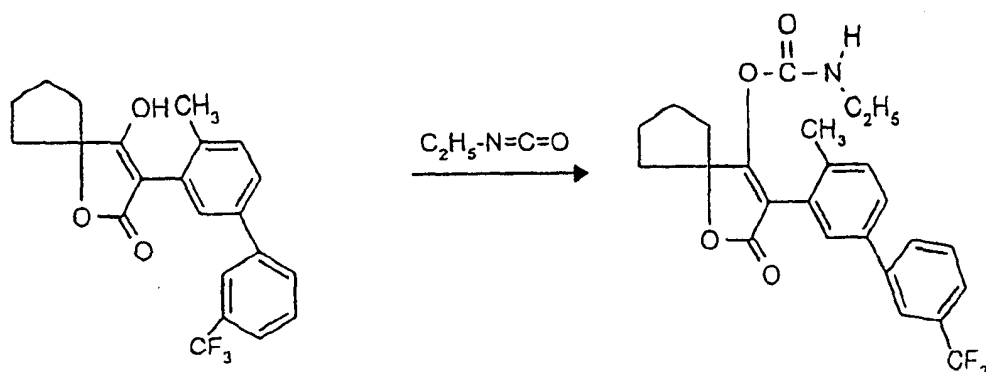
根据方法(N), 使用 2-[(6-甲基-3-苯基)-苯基]-4-羟基-5,5-二甲基- Δ^3 -二氢呋喃-2-酮和甲硫代磷酸氯 2,2,2-三氟乙基酯作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



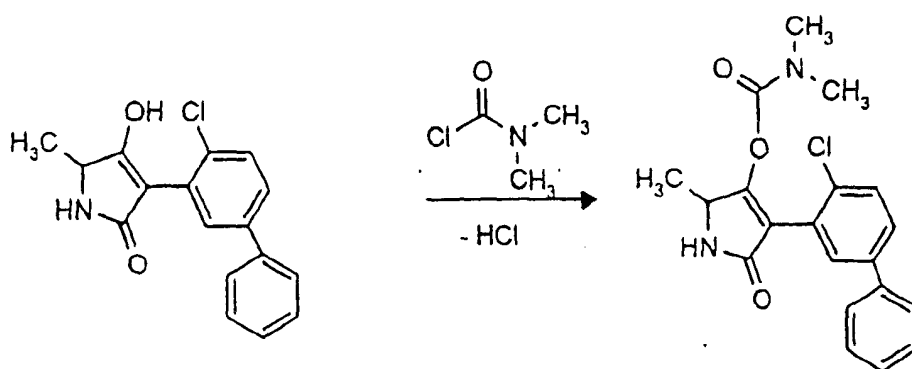
根据方法(O), 使用 3-[(2-三氟甲基-5-(4-三氟甲基-苯基))-苯基]-5-环丙基-5-甲基-吡咯烷-2,4-二酮和氢氧化钠作为组分, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



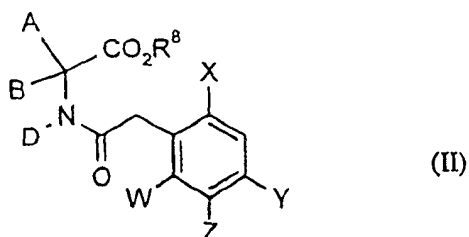
根据方法(P)(方案 α), 使用 3-[(6-甲基-6-(3-三氟甲基-苯基))-苯基]-4-羟基-5-四亚甲基- Δ^3 -二氢呋喃-2-酮和异氰酸乙酯作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



根据方法(P)(方案β)使用3-[(2-氯-5-苯基)-苯基]-5-甲基-吡咯烷-2,4-二酮和二甲基氨基甲酰氯作为起始原料,本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



需在本发明方法(a)中作为起始原料的式(II)化合物是新的

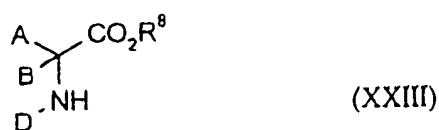


其中

A、B、D、W、X、Y、Z和 R^8 各如上定义。

式(II)的酰基氨基酸酯如下获得,例如,将式(XXIII)的氨基酸

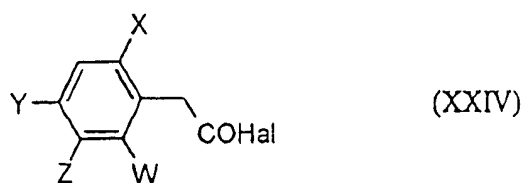
衍生物



其中

A、B、R⁸和D各如上定义，

用式(XXIV)的取代的苯基乙酰氯酰化



其中

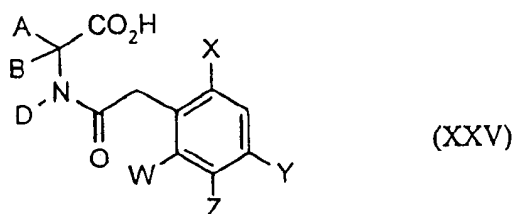
W、X、Y和Z各如上定义，和

Hal 表示氯或溴

(Chem. Reviews 52, 237-416(1953); Bhattacharya, Indian J. Chem. 6, 341-5, 1968)

或

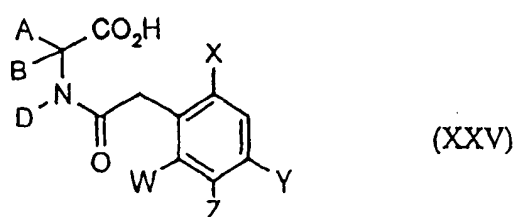
将式(XXV)的酰基氨基酸进行酯化(Chem. Ind. (伦敦)1568(1968)),



其中

A、B、D、W、X、Y和Z各如上所定义。

式(XXV)化合物是新的

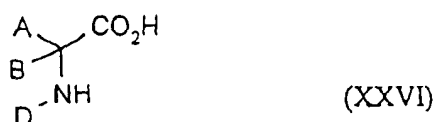


其中

A、B、D、W、X、Y 和 Z 如上定义。

式 (XXV) 化合物如下获得，

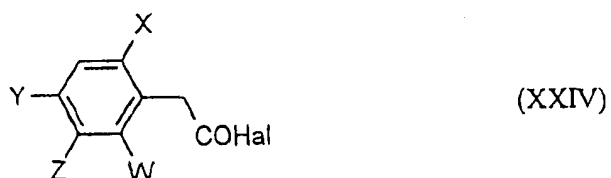
将式 (XXVI) 的氨基酸



其中

A、B 和 D 如上定义

用式 (XXIV) 的取代的苯基乙酰氯酰化，



其中

W、X、Y 和 Z 各如上定义，和

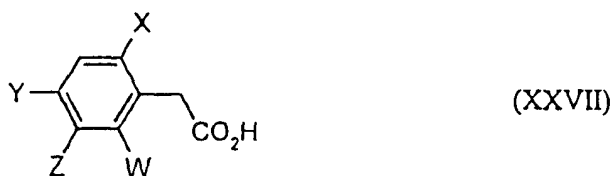
Hal 表示氯或溴，

例如根据 Schotten-Baumann (Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, 柏林 1977, p. 505).

式 (XXIV) 化合物是新的。它们可以根据原则上已知的方法制备 (参见, 例如, H. Henecka, Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Vol. 8, p. 467-469 (1952)).

式 (XXIV) 化合物如下获得, 例如, 如果适宜在稀释剂存在下 (例

如任选氯化的脂族或芳族烃如甲苯或二氯甲烷), 在 -20°C 至 150°C , 优选 -10°C 至 100°C 的温度下, 使式 (XXVII) 的取代的苯基乙酸



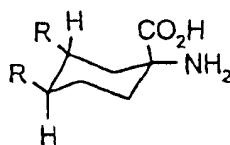
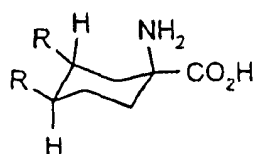
其中

W、X、Y 和 Z 各如上定义,

与卤化剂 (例如, 亚硫酸氯、亚硫酸溴、草酰氯、光气、三氯化磷、三溴化磷或五氯化磷) 反应。

某些式 (XXIII) 和 (XXVI) 化合物是已知的, 和 / 或它们可以通过已知的方法制备 (参见, 例如, Compagnon, Miocque Ann. Chim. (Paris) [14]5, p.11-22, 23-27 (1970)).

其中 A 和 B 形成环的式 (XXVIa) 的取代的环状羧酸通过 Bucherer-Bergs 合成或通过 Strecker 合成常规地获得, 且在每一种情况下, 获得不同的异构体形式。因此, 在 Bucherer-Bergs 合成的条件下, 主要获得其中基团 R 与羧基平伏的异构体 (为简明起见下文称作 β), 而在 Strecker 合成条件下, 主要获得其中基团 R 与氨基基团平伏的异构体 (为简明起见下文称作 α)。



Bucherer-Bergs 合成

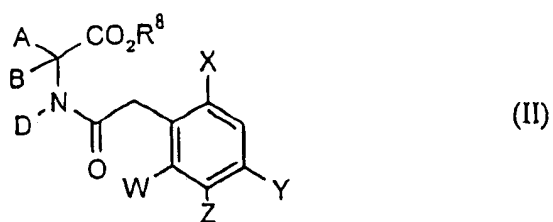
(β 异构体)

Strecker 合成

(α 异构体)

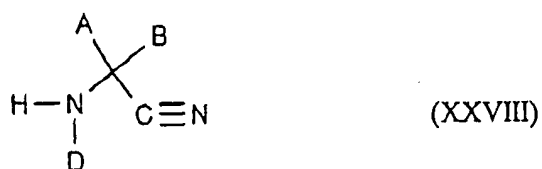
(L. Munday, J. Chem. Soc. 4372 (1961); J. T. Eward, C. Jitrangeri, Can. J. Chem. 53, 3339 (1975)).

再者, 使用于上述方法 (A) 中的式 (II) 起始原料



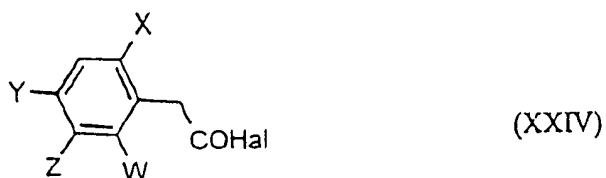
其中

A、B、D、W、X、Y、Z 和 R^8 各如上定义，
可以如下制备，
使式 (XXVIII) 的氨基腈



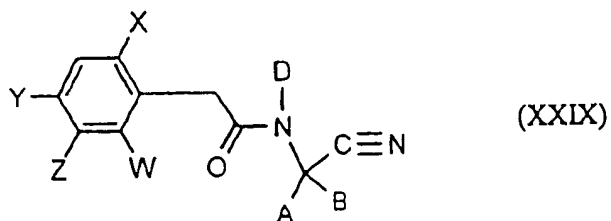
其中

A、B 和 D 各如上定义，
与式 (XXIV) 的取代的苯基乙酰卤反应



其中

W、X、Y、Z 和 Hal 各如上定义，
给出式 (XXIX) 化合物



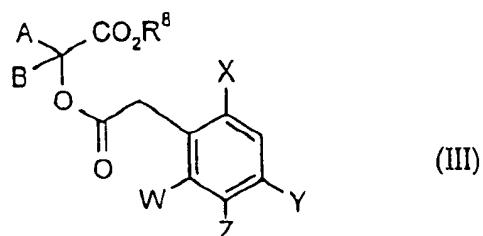
其中

A、B、D、W、X、Y和Z各如上定义，

且它随后进行酸性醇解。

式(XXIX)化合物同样是新的。

需在本发明方法(B)中作为起始原料的式(III)化合物是新的



其中

A、B、W、X、Y、Z和R⁸各如上定义。

它们可以用原则上已知的方法制备。

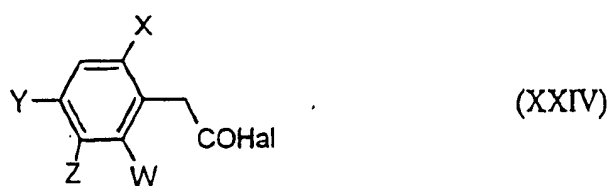
因此，式(III)化合物例如如下获得，将式(XXX)的2-羟基羧酸酯



其中

A、B和R⁸各如上定义，

用式(XXIV)的取代的苯基乙酰卤酰化



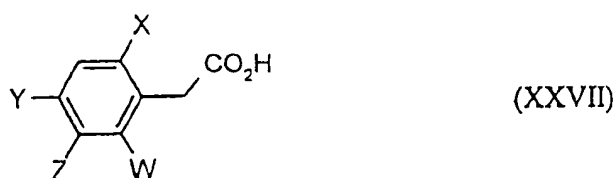
其中

W、X、Y、Z 和 Hal 各如上定义

(Chem. Reviews 52, 237-416(1953)和先前提到的应用例).

再者, 式(III)化合物如下获得

将式(XXVII)的取代的苯基乙酸



其中

W、X、Y 和 Z 各如上定义

用式(XXXI)的 α -卤代羧酸酯烷基化



其中

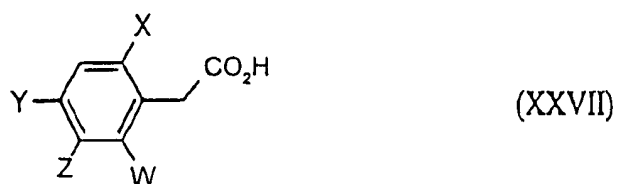
A、B 和 R^b 各如上定义, 和

Hal 表示氯或溴.

式(XXVII)化合物是新的.

式(XXXI)化合物是商业可得的.

式(XXVII)化合物

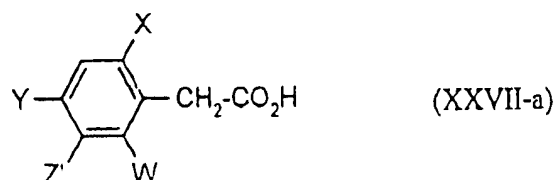


其中

W、X、Y 和 Z 各如上定义，

如下获得，例如

α) 在溶剂、碱和催化剂(优选钯配合物，如四(三苯基膦)钯)存在下，使式(XXVII-a)化合物



其中

X 和 Y 各如上定义，

Z' 表示氯或溴，优选表示溴，

与式(XII)的硼酸反应

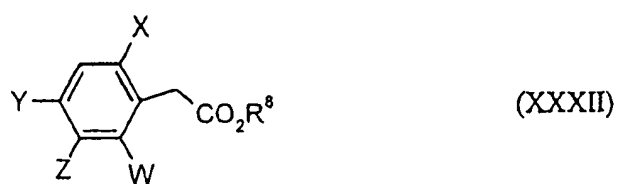


其中

Z 如上定义

或

β) 在通常已知的标准条件下，在酸或碱存在下，在溶剂存在下，将式(XXXII)的苯基乙酸酯进行水解

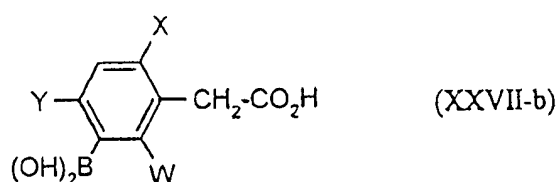


其中

W、X、Y、Z 和 R^8 各如上定义，

或

γ) 在溶剂、碱和催化剂(优选上面提到的钨配合物之一)存在下，
使式(XXVII-b)的苯基乙酸



其中

W、X 和 Z 各如上定义，

与式(XXXIII)的卤素化合物反应



其中

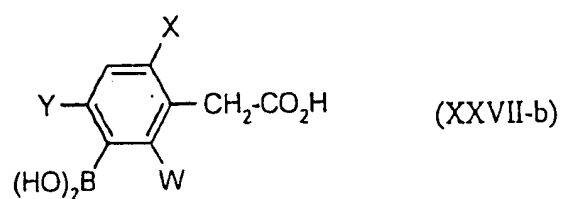
Z 如上定义，和

Hal 表示氯、溴或碘，优选溴和碘。

某些式(XII)和(XXXIII)化合物是已知的，它们中的一些可以商业获得，或它们可以通过原则上已知的方法制备。某些式(XXVII-a)的苯基乙酸由 WO 97/01535、WO 97/36 868 和 WO 98/05 638 已知，或它们可以通过其中描述的方法制备。

式(XXVII-b)和(XXXII)化合物是新的。

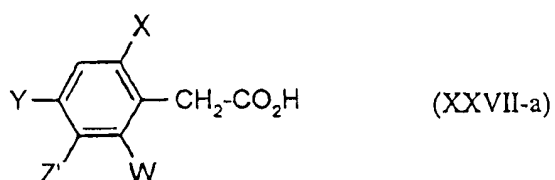
式(XXVII-b)化合物



其中

W、X 和 Y 各如上定义，

如下获得，例如，在稀释剂存在下，使式 (XXVII-a) 的苯基乙酸



其中

W、X、Y 和 Z' 各如上定义

与式 (XXXIV) 的锂化合物



其中

R^{21} 表示 C_1 - C_8 -烷基或苯基，优选表示正- C_4H_9 ，

和式 (XXXV) 的硼酸酯反应

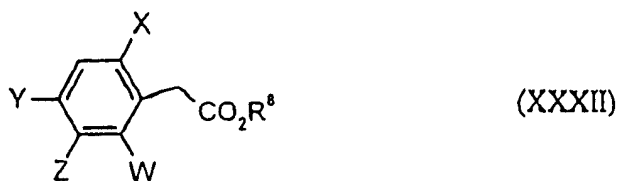


其中

R^8 如上定义。

式 (XXXIV) 和 (XXXV) 化合物商业可得的化合物。

式 (XXXII) 化合物



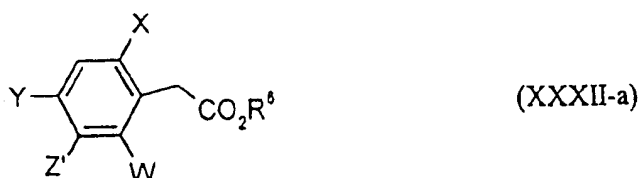
其中

W、X、Y、Z 和 R^8 各如上定义，

如下获得，例如，

在溶剂、碱和催化剂(优选上面提到的钨配合物之一)存在下，

使式(XXXII-a)苯基乙酸酯



其中

R^8 、W、X、Y 和 Z' 各如上定义，

与式(XII)的硼酸反应

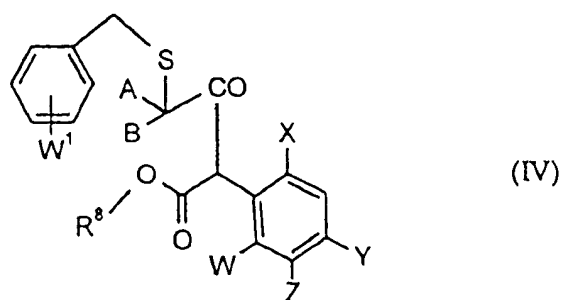


其中

Z 如上定义。

一些式(XXXII-a)的苯基乙酸酯由 WO 97 / 01535、WO 97 / 36868 和 WO 98 / 0563 已知，或它们可以通过其中描述的方法制备。

需在方法(C)中作为起始原料的式(IV)化合物是新的

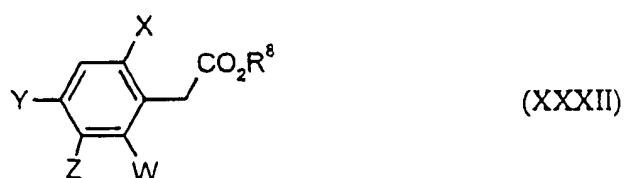


其中

A、B、W、W¹、X、Y、Z 和 R⁸ 各如上定义。

它们通过原则上已知的方法制备。

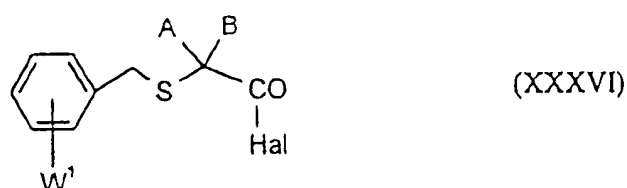
式 (IV) 化合物如下获得，例如，在强碱存在下，将式 (XXXII) 的取代的苯基乙酸酯



其中

W、X、Y、R⁸ 和 Z 各如上定义，

用式 (XXXVI) 的 2-苄硫基-酰基卤酰化



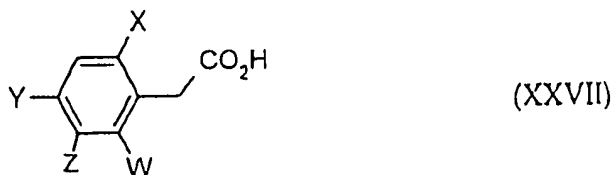
其中

A、B 和 W¹ 各如上定义，和

Hal 表示卤素(特别是氯或溴)

(参见，例如，M. S. Chambers, E. J. Thomas, D. J. William, J. Chem. Soc. Commun., (1987), 1228).

式 (XXXII) 化合物是新的。式 (XXXII) 化合物也可以如下获得：在醇和脱水剂 (例如浓硫酸) 存在下，将式 (XXVII) 化合物



其中

W、X、Y 和 Z 各如上定义，

或醇用式 (XXIV) 化合物酰化 (Chem. Reviews 52, 237-416 (1953))

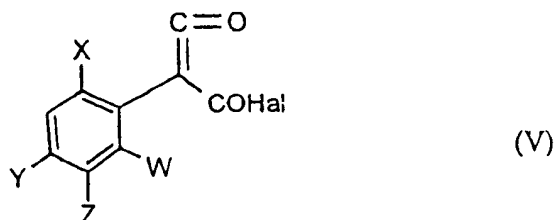


其中

W、X、Y、Z 和 Hal 各如上定义。

一些式 (XXXVI) 的苄硫基-酰基卤是已知的和/或它们可以用已知的方法制备 (J. Antibiotics (1983), 26, 1589).

需在方法 (D)、(E) 和 (F) 中作为起始原料的式 (V) 的卤代羧基烯酮是新的。它们可以通过原则上已知的方法制备 (参见, 例如, Org. Prep. Proced. Int., 7, (4), 155-158, 1975 和 DE 1 945 703). 因此, 例如, 式 (V) 化合物



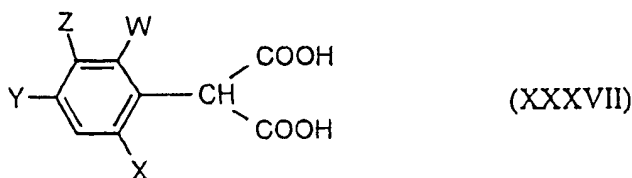
其中

W、X、Y和Z各如上定义，且

Hal 表示氯或溴

如下获得

使式 (XXXVII) 的取代的苯基丙二酸



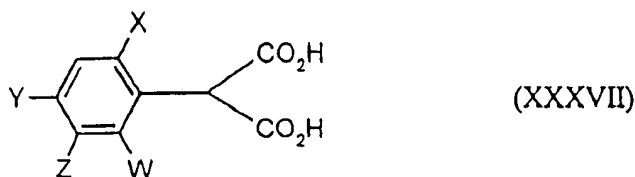
其中

W、X、Y和Z各如上定义

与酰基卤，例如，亚硫酸氯、五氯化磷(V)、三氯化磷(III)、草酰氯、光气或亚硫酸溴，如果适宜在催化剂如二甲基甲酰胺、甲基-steryl-甲酰胺或三苯基磷存在下，和如果适宜在碱如吡啶或三乙胺存在下，进行反应。

式 (XXXVII) 的取代的苯基丙二酸是新的。它们可以用简单的方法制备 (参见，例如，Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, 柏林 1977, p.517 ff, EP-A-528 156, WO 97/36868, WO 97/01535 和 WO 98/05638)。

因此，式 (XXXVII) 的苯基丙二酸

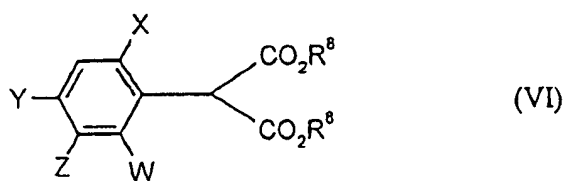


其中

W、X、Y和Z各如上定义

如下获得

先将式 (VI) 的苯基丙二酸酯

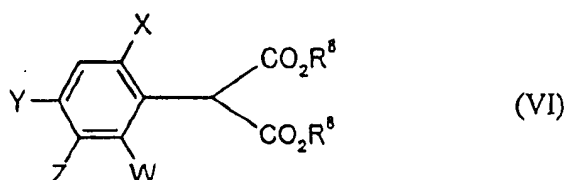


其中

W、X、Y、Z 和 R^8 各如上定义

在碱存在下和在溶剂中水解，随后小心酸化 (EP-528 156、WO 97/36868、WO 97/01535)。

式 (VI) 的丙二酸是新的



其中

W、X、Y、Z 和 R^8 各如上定义。

它们可以通过一般已知的有机化学方法制备 (参见，例如，《四面体通讯》[Tetrahedron Lett.] 27, 2763 (1986) 和 Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, 柏林 1977, p. 587ff.).

一些需在本发明方法 (D) 中作为起始原料的式 (VII) 胍是已知的



其中

A 和 D 各如上定义，

和/或它们可以通过由文献已知的方法制备 (参见，例如，Liebigs Ann. Chem. 585, 6 (1954); Reaktionen der organischen Synthese, C. Ferri, p. 212, 513; Georg Thieme Verlag Stuttgart, 1978; Liebigs Ann. Chem. 443, 242 (1925); Chem. Ber. 98, 2551 (1965), EP-508 126).

需在本发明方法 (E) 中作为起始原料的式 (VIII) 的羰基化合物



其中

A 和 D 各如上定义

或式 (VIIIa) 的其甲硅烷基烯醇醚



其中

A、D 和 R^8 各如上定义

是商业可得的通常已知化合物或可以用已知方法获得的化合物。

需在本发明方法 (F) 中作为起始原料的式 (V) 的烯酮酰基氯的制备在上文中已作了描述。进行方法 (F) 所需的式 (IX) 的硫代酰胺

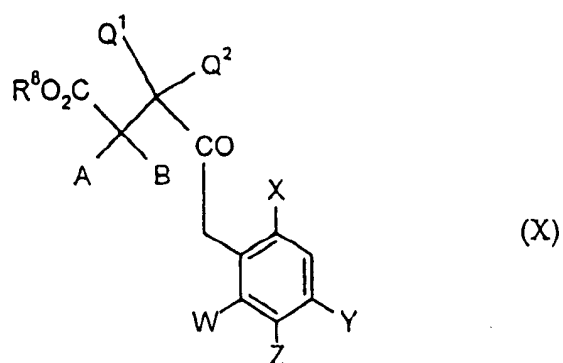


其中

A 如上定义

是有机化学上通常已知的化合物。

需在上述方法 (G) 中作为起始原料的式 (X) 化合物是新的

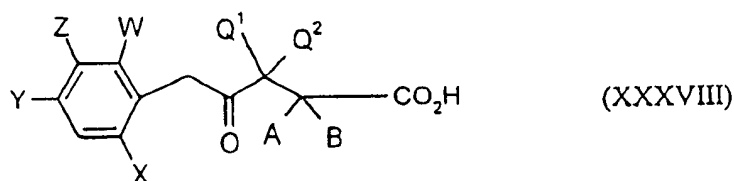


其中

A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z 和 R⁸ 各如上定义。

它们可以用原则上已知的方法制备。

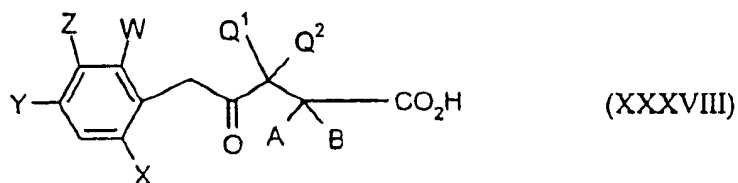
式(X)化合物如下获得, 例如, 将式(XXXVIII)化合物酯化(参见, 例如, Organikum, 15th, 柏林, 1977, p. 499)或烷基化(参见制备实施例)



其中

W、X、Y、Z、A、B、Q¹ 和 Q² 各如上定义。

式(XXXVIII)化合物是新的

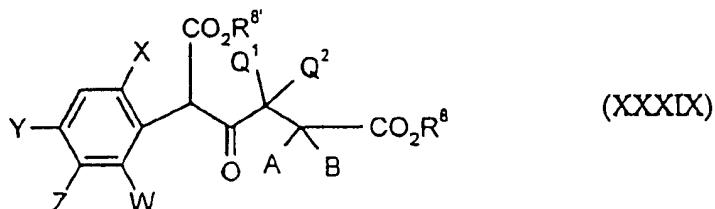


其中

A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 各如上定义,

但它们可以通过原则上已知的方法制备(参见制备实施例)。

式(XXXVIII)的5-芳基-4-酮羧酸如下获得,例如,使式(XXXIX)的2-苯基-3-氧代-己二酸酯



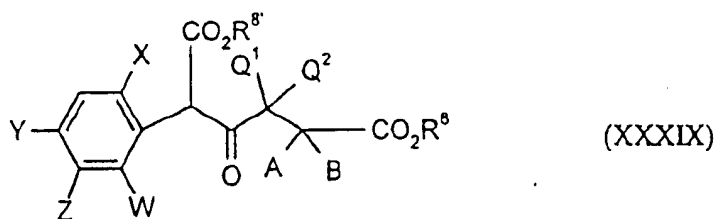
其中

A、B、D¹、D²、W、X、Y和Z各如上定义,和

R⁸和R^{8'}各表示烷基(特别是C₁-C₈-烷基)

如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在碱或酸存在下,进行脱羧酸反应(参见,例如,Organikum, 15th, 柏林, 1977, pp. 519-521).

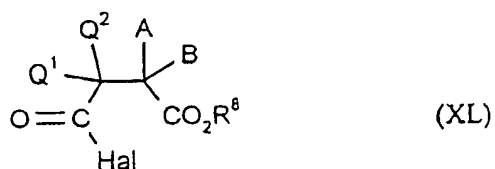
式(XXXIX)化合物是新的



其中

A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z、R⁸和R^{8'}各如上定义.

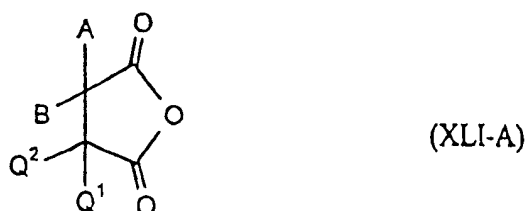
式(XXXIX)化合物如下获得,例如,将式(XL)的二羧酸单酯酰基
氯



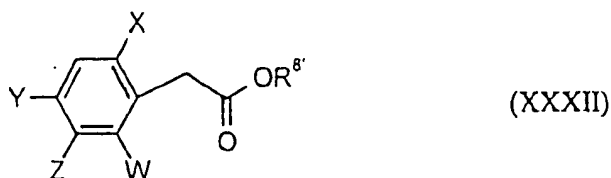
其中

A、B、Q¹、Q²和R⁸各如上定义和

Hal 表示氯或溴,
或式(XLI-A)的羧酸酐



其中
A、B、Q¹和Q²各如上定义,
用式(XXXII)的苯基乙酸酯酰化

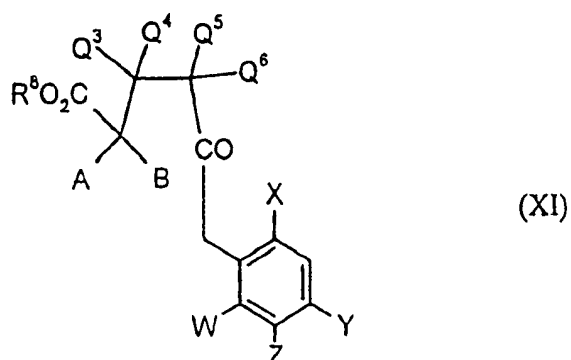


其中
W、X、Y、Z和R⁸如上定义,

反应在稀释剂存在下和在碱存在下进行(参见,例如, M. S. Chambers, E. J. Thomas, D. J. Williams, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228, 参见, 制备实施例)。

一些式(XL)和(XLI-A)化合物是已知的或是商业可得的有机化学化合物, 和/或它们可以用简单的方式用原则上已知的方法制备。

需在方法(H)中作为起始原料的式(XI)化合物是新的

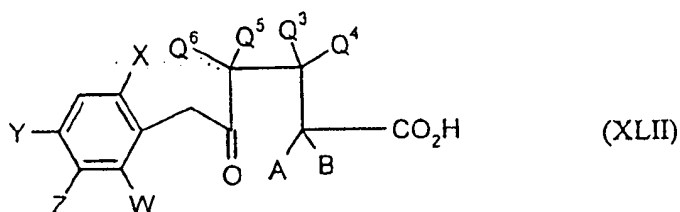


其中

A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y、Z 和 R⁸ 各如上定义。

它们可以用原则上已知的方法制备。

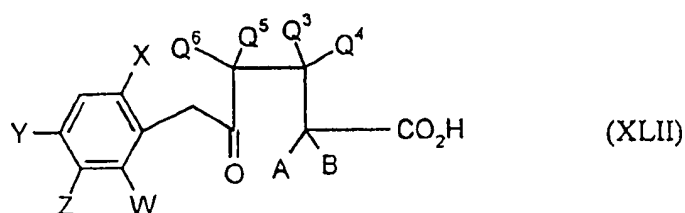
式(XI)的 6-芳基-5-酮羧酸酯如下获得, 例如, 将式(XLII)的 6-芳基-5-酮羧酸酯化(参见, 例如, Organikum, 15th edition, 柏林, 1977, p. 499)



其中

A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y 和 Z 各如上定义。

式(XLII)化合物是新的

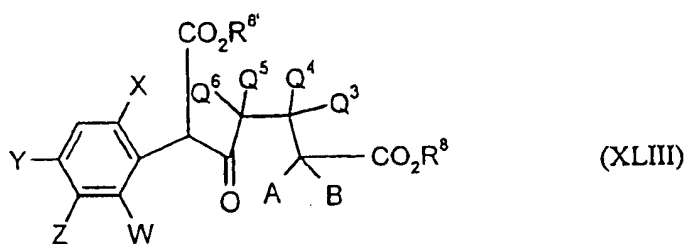


其中

A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y 和 Z 各如上定义。

它们可以通过原则上已知的方法制备, 例如, 通过将式(XLIII)的取

代的 2-苯基-3-氧代-庚二酸酯



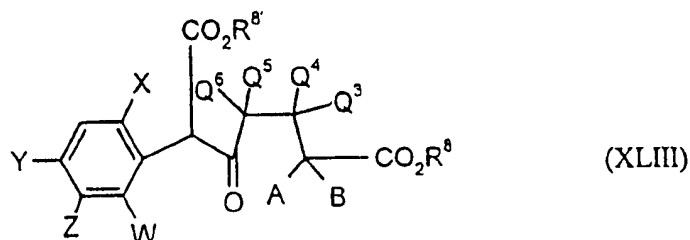
其中

A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y 和 Z 各如上定义，和

R⁸ 和 R^{8'} 各表示烷基 (优选 C₁-C₆-烷基)，

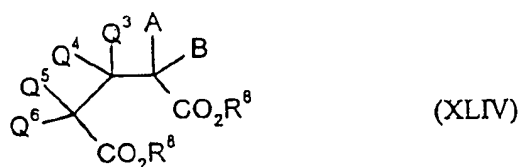
水解或脱羧酸，如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在碱或酸存在下进行 (参见，例如，Organikum, 15th edition, 柏林, 1977, pp. 519-521) (另可参见制备实施例)。

式 (XLIII) 化合物是新的



其中

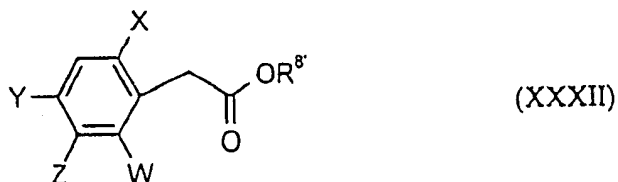
A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y、Z、R⁸ 和 R^{8'} 各如上定义，它们可以如下获得，例如，在稀释剂存在下和在碱存在下，将式 (XLIV) 的二羧酸酯



其中

A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶和R⁸各如上定义

与式(XXXII)的取代的苯基乙酸酯缩合(参见, 制备实施例)

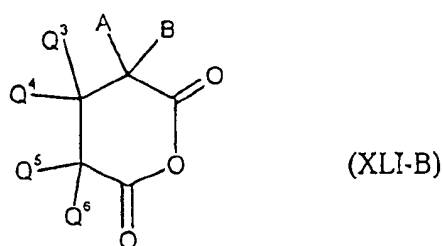


其中

W、X、Y、Z和R⁸各如上定义。

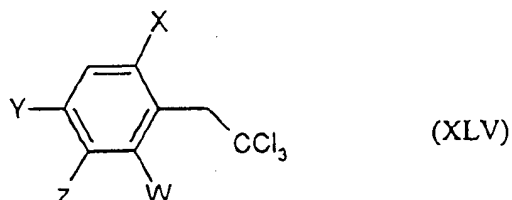
一些式(XLIV)化合物是已知的, 和/或它们可以通过已知的方式制备。

除了式(XLIV)化合物之外, 也可以采用相应的酸酐。之后反应与制备式(X)化合物时那样进行, 其中式(XLI-B)的酸酐用作起始原料。一些式(XLI-B)化合物是已知的, 或是商业可得的化合物。



式(XXXII)化合物业已描述于方法(B)的前体制备中。

式(XXXII)化合物可以通过如下方式获得, 例如, 先使式(XLV)的取代的1,1,1-三氯-2-苯基乙烷



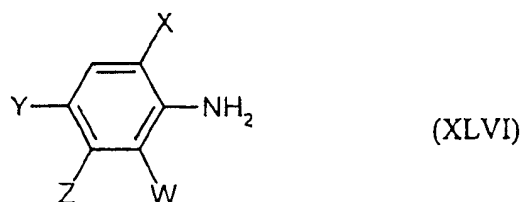
其中

W、X、Y和Z各如上定义,

在稀释剂(例如由醇盐衍生的醇)存在下,在 0℃至 150℃的温度下,优选在 20℃至 120℃下,与醇盐(例如,碱金属醇盐如甲醇钠或乙醇钠)反应,随后在-20℃至 150℃,优选在 0℃至 100℃下,与酸(优选无机酸,例如,硫酸)反应(参见,DE 3 314 249).

式(LXV)化合物是新的;它们可以通过原则上已知的方法制备.

式(XLV)化合物如下获得,例如,式(XLVI)的苯胺



其中

W、X、Y和Z各如上定义,

在式(XLVII)的烷基腈存在下



其中

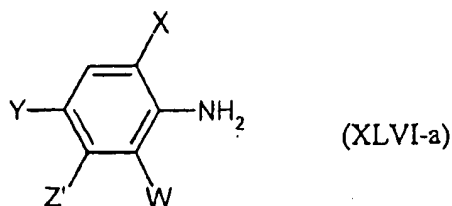
R^{21} 表示烷基,优选 C_1-C_6 -烷基,

在氯化铜(II)存在下,如果适宜在稀释剂(例如脂族腈如乙腈存在下),在-20℃至 80℃,优选 0℃至 60℃温度下,与二氯乙烯($CH_2=CCl_2$)反应.

式(XLVII)化合物是有机化学已知的化合物.氯化铜(II)和二氯乙烯是早就知道的且是商业可得的.

一些式(XLVI)的苯胺是新的.

式(XLVI)的苯胺如下获得,例如,在溶剂、碱和催化剂(优选钨配合物,如,四(三苯基膦)钨)存在下,使式(XLVI-a)的苯胺

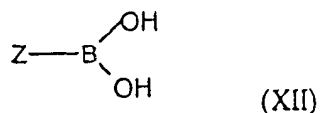


其中

W、X 和 Y 各如上定义，和

Z' 表示氯或溴，优选溴，

与式 (XII) 的硼酸反应



其中

Z 如上定义。

式 (XLVI-a) 的苯胺是已知的化合物，或它们可以用已知的方法制备。

需在上述方法 (I) 中作为起始原料的一些其中 A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X 和 Y 各如上定义且 Z' 表示氯和溴的式 (I-1'-a) 至 (I-8'-a) 的化合物是已知的 (WO 96/35 664、WO 97/02 243 和 WO 98/05 638) 或它们可以用描述于其中的方法或通过方法 (A) 至 (H) 制备。

一些式 (XII) 的硼酸



其中

Z 如上定义

是商业可得的，或它们可以通过一般已知的方法用简单地方式制备。

需在本发明方法 (J)、(K)、(L)、(M)、(N)、(O) 和 (P) 中作为起

始原料的式(XIII)的酰基卤、式(XIV)的羧酸酐、式(XV)氯甲酸酯或氯甲酸硫代酯、式(XVI)的氯单硫代甲酸酯或氯二硫代甲酸酯、式(XVII)磺酰氯、式(XVIII)的磷化合物、式(XIX)和(XX)的金属氢氧化物、金属醇盐或胺和式(XXI)的异氰酸酯和式(XXII)的氨基甲酰氯是有机或无机化学上通常已知的化合物。

而且, 式(VII)、(VIII)、(IX)、(XIII)至(XXIII)、(XXVI)、(XXVIII)、(XXX)、(XXXVI)、(XL)、(XLI)和(XLIV)化合物由开头所引述的专利申请已知, 和/或其中给出的方法制备。

方法(A)的特征在于, 其中A、B、D、W、X、Y、Z和R⁸各如上定义的式(II)化合物在碱存在下进行分子内缩合。

适合于本发明方法(A)的稀释剂是所有的惰性有机溶剂。优选的是烃类, 如甲苯和二甲苯, 以及醚类, 如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲基醚和二甘醇二甲基醚, 而且还有极性溶剂, 如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和N-甲基-吡咯烷酮, 以及醇类, 如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

适合于进行本发明方法(A)的碱(脱质子剂)是所有的常规质子受体。优选的是使用碱金属和碱土金属氧化物、氢氧化物和碳酸盐, 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, 它还可以在相转移催化剂存在下采用, 如三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化铵、Adogen 464(=甲基三烷基(C₈-C₁₀)氯化铵或TDA 1(=三(甲氧基乙氧基乙基)-胺)。也可以使用碱金属如钠和钾。再者, 碱金属和碱土金属氯化物或氢化物, 如氯化钠、氯化钾和氯化钙, 另外还可以使用碱金属醇盐, 如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

当进行本发明方法(A)时, 反应温度可以在相对宽的范围内进行。通常, 反应是在0℃至250℃, 优选在50℃至150℃间的温度下。

本发明方法(A)通常在常压下进行。

进行本发明方法(A)时, 反应组分式(II)和脱质子碱通常采用大约双倍摩尔量。然而, 还可以过量使用一种或另一种组分(至多达3摩尔)。

方法(B)的特征在于, 其中A、B、W、X、Y、Z和R⁸各如上定义的式(III)化合物在稀释剂和碱存在下进行分子内缩合。

适合于本发明方法(B)的稀释剂是所有的惰性有机溶剂。优选的

是使用烃类，如甲苯和二甲苯，以及醚类，如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲基醚和二甘醇二甲基醚，以及极性溶剂，如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和 N-甲基-吡咯烷酮，和醇类，如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

适合于进行本发明方法(B)的碱(脱质子剂)是所有的常规质子受体。优选的是使用碱金属和碱土金属氧化物、氢氧化物和碳酸盐，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，它还可以在相转移催化剂存在下采用，如三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化铵、Adogen 464(=甲基三烷基(C₈-C₁₀)氯化铵或 TDA 1(=三(甲氧基乙氧基乙基)-胺)。也可以使用碱金属如钠和钾。再者，碱金属和碱土金属氧化物或氢化物，如氧化钠、氢化钠和氢化钙，另外还可以使用碱金属醇盐，如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

当进行本发明方法(B)时，反应温度可以在相对宽的范围进行。通常，反应是在 0℃至 250℃，优选在 50℃至 150℃间的温度下。

本发明方法(B)通常在常压下进行。

进行本发明方法(B)时，反应组分式(III)和脱质子碱通常采用大约等摩尔量。然而，还可以过量使用一种或另一种组分(至多达 3 摩尔)。

方法(C)的特征在于，其中 A、B、W、X、Y、Z 和 R⁰各如上定义的式(IV)化合物在酸存在下和如果适宜在稀释剂存在下进行分子内环化。

适合于本发明方法(C)的稀释剂是所有的惰性有机溶剂。优选的是使用烃类，如甲苯和二甲苯，以及卤代烃类，如二氯甲烷、氯仿、二氯乙烷、氯苯、二氯苯，以及极性溶剂，如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和 N-甲基-吡咯烷酮，和醇类，如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

如果适宜，所使用的酸也可以用作稀释剂。

适宜于本发明方法(C)的酸是所有的常规无机或有机酸，如氢卤酸类、硫酸、烷基-、芳基-和卤代烷基-磺酸，特别是卤代烷基羧酸，如三氯乙酸。

当进行本发明方法(C)时，反应温度可以在相对宽的范围进行。通常，反应是在 0℃至 250℃，优选在 50℃至 150℃间的温度下。

本发明方法(C)通常在常压下进行。

进行本发明方法(C)时,反应组分式(IV)和酸采用例如等摩尔量。然而,如果适宜还可以使用所述酸作为溶剂或作为催化剂。

方法(D- α)和(D- β)的特征在于,如果适宜在碱存在下和如果适宜在稀释剂存在下,使其中W、X、Y、Z、R⁸和Hal各如上定义的式(V)或(VI)化合物与其中A和D各如上定义的式(VII)化合物反应。

适合于本发明方法(D- α)和(D- β)的稀释剂是所有的惰性有机溶剂。优选的是烃类,如甲苯和二甲苯,以及醚类,如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲基醚和二甘醇二甲基醚,而且还有极性溶剂,如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和N-甲基-吡咯烷酮,以及在采用式(VI)化合物的情况下,可以是醇类,如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

当采用式(V)化合物时,适宜的碱是无机碱,尤其是碱金属和碱土金属碳酸盐,如碳酸钠、碳酸钾或碳酸钙,以及有机碱,如吡啶或三乙胺;而当采用式(VI)化合物时,适宜的碱是碱金属和碱土金属氧化物、氢氧化物和碳酸盐,如氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙,它还可以在相转移催化剂存在下采用,如三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化铵、Adogen 464(=甲基三烷基(C₈-C₁₀)氯化铵或TDA 1(=三(甲氧基乙氧基乙基)-胺)。也可以使用碱金属如钠和钾,碱金属和碱土金属氯化物或氢化物,如氯化钠、氯化钾和氯化钙,另外还可以使用碱金属醇盐,如甲醇钠和叔丁醇钾。

当进行本发明方法(D- α)和(D- β)时,反应温度可以在相对宽的范围内进行。通常,反应是在-20℃至250℃,优选在0℃至150℃间的温度下进行。

本发明方法(D- α)和(D- β)通常在常压下进行。

进行本发明方法(D- α)和(D- β)时,反应组分式(V)和(VII)或(VI)和(VII)和任选地使用的脱质子碱通常采用大约等摩尔量。然而,还可以过量使用一种或另一种组分(至多达3摩尔)。

方法(E)的特征在于,在稀释剂存在下和如果适宜在酸受体存在下,使式(VIII)羰基化合物或式(VIII-a)的其烯醇醚与式(V)的烯酮酰基卤反应。

适合于本发明方法(E)的稀释剂是所有的惰性有机溶剂。优选的

是使用烃类, 如甲苯和二甲苯, 以及醚类, 如二丁醚、乙二醇二甲基醚和二甘醇二甲基醚, 以及极性溶剂, 如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和 N-甲基-吡咯烷酮。

适合于本发明方法 (E) 的酸受体是所有的常规酸受体。

优选的是使用叔胺, 如三乙胺、吡啶、二氮杂二环辛烷 (DABCO)、二氮杂二环十一烷 (DBU)、二氮杂二环壬烯 (DBN)、Hünig 碱和 N,N-二甲基-苯胺。

当进行本发明方法 (E) 时, 反应温度可以在相对宽的范围内进行。通常, 反应是在 0℃ 至 250℃, 优选在 50℃ 至 220℃ 间的温度下。

本发明方法 (E) 通常在常压下进行。

进行本发明方法 (E) 时, 其中 A、D、W、X、Y 和 Z 各如上定义且 Hal 表示卤素的式 (VIII) 和 (V) 反应组分和如果适宜酸受体通常采用大约等摩尔量。然而, 还可以相对大地过量使用一种或另一种组分 (至多达 5 摩尔)。

方法 (F) 的特征在于, 式 (IX) 的硫代酰胺与式 (V) 的烯酮酰基卤在稀释剂存在下和如果适宜在酸受体存在下进行反应。

适合于本发明方法 (F) 的稀释剂是所有的惰性有机溶剂。优选的是使用烃类, 如甲苯和二甲苯, 以及醚类, 如二丁醚、乙二醇二甲基醚和二甘醇二甲基醚, 以及极性溶剂, 如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和 N-甲基-吡咯烷酮。

适合于本发明方法 (F) 的酸受体是所有的常规酸受体。

优选的是使用叔胺, 如三乙胺、吡啶、二氮杂二环辛烷 (DABCO)、二氮杂二环十一烷 (DBU)、二氮杂二环壬烯 (DBN)、Hünig 碱和 N,N-二甲基-苯胺。

当进行本发明方法 (F) 时, 反应温度可以在相对宽的范围内进行。通常, 反应是在 0℃ 至 250℃, 优选在 20℃ 至 220℃ 间的温度下进行。

本发明方法 (F) 通常在常压下进行。

进行本发明方法 (F) 时, 其中 A、W、X、Y 和 Z 各如上定义和 Hal 表示卤素的式 (IX) 和 (V) 反应组分和任选使用的酸受体通常采用大约等摩尔量。然而, 还可以过量使用一种或另一种组分 (至多达 5 摩尔)。

方法 (G) 的特征在于, 其中 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z 和 R⁸ 各如

上定义的式(X)化合物在碱存在下进行分子内缩合。

适合于本发明方法(G)的稀释剂是所有的对反应参与者为惰性的有机溶剂。优选的是烃类,如甲苯和二甲苯,以及醚类,如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲基醚和二甘醇二甲基醚,而且还有极性溶剂,如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和N-甲基-吡咯烷酮,以及可以是醇类,如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

适合于进行本发明方法(G)的碱(脱质子剂)是所有的常规质子受体。优选的是使用是碱金属和碱土金属氧化物、氢氧化物和碳酸盐,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,它还可以在相转移催化剂存在下采用,如三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化铵、Adogen 464(=甲基三烷基(C₆-C₁₀)氯化铵或TDA 1(=三(甲氧基乙氧基乙基)-胺)。也可以使用碱金属如钠和钾。再者,还有碱金属和碱土金属氯化物或氢化物,如氯化钠、氯化钾和氯化钙,另外还可以使用碱金属醇盐,如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

当进行本发明方法(G)时,反应温度可以在相对宽的范围内进行。通常,反应是在-75℃至250℃,优选在-50℃至150℃间的温度下。

本发明方法(G)通常在常压下进行。

进行本发明方法(G)时,式(X)反应组分和脱质子碱通常采用大约等摩尔量。然而,还可以过量使用一种或另一种组分(至多达3摩尔)。

方法(H)的特征在于,其中A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y、Z和R⁸各如上定义的式(XI)在碱存在下进行分子内缩合。

适合于本发明方法(H)的稀释剂是所有的惰性有机溶剂。优选的是烃类,如甲苯和二甲苯,以及醚类,如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲基醚和二甘醇二甲基醚,而且还有极性溶剂,如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和N-甲基-吡咯烷酮,以及可以是醇类,如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

适合于进行本发明方法(H)的碱(脱质子剂)是所有的常规质子受体。优选的是碱金属和碱土金属氧化物、氢氧化物和碳酸盐,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,它还可以在相转移催化剂存在下采用,如三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化

铵、Adogen 464(=甲基三烷基(C₈-C₁₀)氯化铵或 TDA 1(-三(甲氧基乙氧基乙基)-胺)。也可以使用碱金属如钠和钾。再者,还有碱金属和碱土金属氯化物或氢化物,如氯化钠、氯化钾和氯化钙,另外还可以使用碱金属醇盐,如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

当进行本发明方法(H)时,反应温度可以在相对宽的范围内进行。通常,反应是在0℃至250℃,优选在50℃至150℃间的温度下。

本发明方法(H)通常在常压下进行。

进行本发明方法(H)时,式(XII)反应组分和脱质子碱通常采用大约等摩尔量。然而,还可以过量使用一种或另一种组分(至多达3摩尔)。

进行本发明方法(I)时,钪(0)配合物适合作为催化剂。优选的是例如四(三苯基膦)钪。如果适宜,也可以使用钪(II)化合物,如氯化钪(II)。

适合于本发明方法(I)的酸受体是无机或有机碱。优选的碱包括碱土金属或碱金属氢氧化物、乙酸盐、碳酸钠或碳酸氢盐,如氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化钡或氢氧化铵、乙酸钠、乙酸钾、乙酸钙或乙酸铵、碳酸钠、碳酸钾或碳酸铵、碳酸氢钠或碳酸氢钾,碱金属氯化物,如,氯化铯,以及叔胺,如三甲胺、三乙胺、三丁胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基苄基胺、吡啶、N-甲基吡啶、N-甲基吗啉、N,N-二甲基氨基吡啶、二氮杂双环辛烷(DABCO)、二氮杂双环壬烷(DBN)或二氮杂双环十一碳烯(DBU)。

适合于进行本发明方法(I)的稀释剂是水、有机溶剂及其任一种混合物。实例包括:脂族、脂环族或芳族烃类,如石油醚、己烷、庚烷、环己烷、甲基环己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氢化萘;卤代烃类,如氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷、三氯乙烷或四氯乙烯;醚类,如乙醚、二异丙醚、甲基叔丁基醚、甲基叔戊基醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷、二甘醇二甲基醚或苯甲醚;醇类,如甲醇、乙醇、正-或异丙醇、正-、异-、仲-和叔-丁醇、乙二醇、丙-1,2-二醇、乙氧基乙醇、甲氧基乙醇、二甘醇单甲醚、二甘醇单乙醚;水。

当进行本发明方法(I)时,反应温度可以在相对宽的范围内进行。通常,反应是在0℃至140℃,优选在50℃至100℃间的温度下。

进行本发明方法(I)时,其中Z如上定义的式(XII)硼酸和其中A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y和Z各如上定义的式(I-1-a)至式(I-8-a)化合物以1:1至3:1、优选以1:1至2:1的摩尔比使用。每摩尔的式(I-1-a)至(I-8-a)化合物通常采用0.005至0.5摩尔,优选0.01至0.1摩尔催化剂,通常过量使用碱。

方法(J- α)的特征在于,式(I-1-a)至(I-8-a)化合物在每一种情况下与式(XIII)的酰基卤反应,如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下反应。

适合于本发明方法(J- α)的稀释剂是所有的对酰基卤惰性的溶剂,优选使用烃类,如汽油、苯、甲苯、二甲苯和四氢化萘,以及卤代烃类,如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、氯苯和邻二氯苯,还有酮类,如丙酮和甲基异丁基酮,以及醚类,如乙醚、四氢呋喃和二噁烷,另外还有羧酸酯类,如乙酸乙酯,以及强极性溶剂,如二甲亚砜和环丁砜。如果酰基卤的水解稳定性许可,反应还可以在水中进行。

适合于本发明方法(J- α)的酸结合剂是所有的常规酸受体,优选的是使用叔胺,如三乙胺、吡啶、二氮杂双环辛烷(DABCO)、二氮杂双环十一碳烯(DBU)、二氮杂双环壬烯(DBN),Hünig碱和N,N-二甲基-苯胺,以及碱土金属氧化物,如氧化镁和氧化钙,而且还有碱金属和碱土金属碳酸盐,如碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙,以及碱金属氢氧化物如氢氧化钠和氢氧化钾。

当进行本发明方法(J- α)时,反应温度可以在相对宽的范围内进行。通常,反应是在-20℃至+150℃,优选在0℃至100℃间的温度下。

进行本发明方法(J- α)时,式(I-1-a)至(I-8-a)起始原料和式(XIII)酰基卤在每一种情况下通常采用大约等摩尔量。然而,还可以相对大过量(至多达5摩尔)地使用酰基卤。后处理是通过常规方法进行的。

方法(J- β)的特征在于,如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下,使式(I-1-a)至(I-8-a)化合物与式(XIV)的羧酸酐反应。

对本发明方法(J- β)而言优选的稀释剂是那些当使用酰基卤时为优选的稀释剂。而且,也可能过量使用羧酸同时作为稀释剂。

在本发明方法(J-β)中, 如果适宜加入的酸结合剂, 优选是使用酰基卤时亦是优选的酸结合剂。

在本发明方法(J-β)中, 反应温度可以在相对宽的范围内变化。通常, 反应是在-20℃至+150℃, 优选是在0℃至100℃间的温度下进行。

进行本发明方法(J-β)时, 式(I-1-a)至(I-8-a)起始原料和式(XIV)酸酐在每一种情况下通常采用大约等摩尔量。然而, 还可以相对大过量(至多达5摩尔)地使用酰基卤。后处理是通过常规方法进行的。

通常, 采用的步骤是去除稀释剂和过量的羧酸酐, 以及通过蒸馏或通过用有机溶剂或用水洗涤形成的羧酸。

方法(K)的特征在于, 如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下, 使式(I-1-a)至(I-8-a)化合物在每一种情况下与式(XV)的氯甲酸酯或氯甲酸硫醇酯反应。

适合于本发明方法(K)的酸结合剂是所有的常规酸受体。优选的是使用叔胺, 如三乙胺、吡啶、DABCO、DBU、DBA, Hünig碱和N,N-二甲基-苯胺, 以及碱土金属氧化物, 如氧化镁和氧化钙, 而且还有碱金属和碱土金属碳酸盐, 如碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙, 以及碱金属氢氧化物如氢氧化钠和氢氧化钾。

适合于本发明方法(K)的稀释剂是所有的对氯甲酸酯或氯甲酸硫醇酯惰性的溶剂。优选使用烃类, 如汽油、苯、甲苯、二甲苯和四氢化萘, 以及卤代烃类, 如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、氯苯和邻二氯苯, 还有酮类, 如丙酮和甲基异丁基酮, 以及醚类, 如乙醚、四氢呋喃和二噁烷, 另外还有羧酸酯类, 如乙酸乙酯, 以及强极性溶剂, 如二甲亚砜和环丁砜。

当进行本发明方法(K)时, 反应温度可以在相对宽的范围内进行。通常, 反应是在-20℃至+100℃, 优选在0℃至50℃间的温度下进行。

本发明方法(K)通常是在常压下进行的。

进行本发明方法(K)时, 式(I-1-a)至(I-8-a)起始原料和适宜的式(XV)氯甲酸酯或氯甲酸硫醇酯在每一种情况下通常采用大约等摩尔量。然而, 还可以相对大过量(至多达2摩尔)地使用一种或另一种

组分。后处理是通过常规方法进行的。通常，去除沉淀出的盐且余下的反应混合物通常汽提掉稀释剂来浓缩。

本发明方法(L)的特征在于，在稀释剂存在下，和如果适宜在酸结合剂存在下，使式(I-1-a)至(I-8-a)化合物在每一种情况下与式(XVI)化合物反应。

在制备方法(L)中，大约1摩尔的式(XVI)的氯单硫代甲酸酯或氯二硫代甲酸酯与每摩尔的式(I-1-a)至(I-8-a)起始原料在0至120℃，优选20至60℃反应。

如果适宜加入的稀释剂，是所有的极性有机溶剂，如醚类、酰胺类、砜类、亚砜类，也可以是卤代烷类。

优选的是使用二甲亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺或二氯甲烷。

在优选的实施方案中，如果通过加入强脱质子剂如氢化钠或叔丁醇钾来制备式(I-1-a)至(I-8-a)化合物的烯醇盐，则不需要加入另外的酸结合剂。

如果采用酸结合剂，则是常规无机或有机碱，例如，氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、吡啶、三乙胺。

反应可以在常压下进行，或在加压下进行，优选是在常压下进行。后处理是通过常规方法进行。

本发明方法(M)的特征在于，如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下，使式(I-1-a)至(I-8-a)化合物在每一种情况下与式(XVII)的磺酰氯反应。

在制备方法(M)中，大约1摩尔式(XVII)的磺酰氯与每摩尔的式(I-1-a)至(I-8-a)起始原料在-20至150℃，优选在20至70℃的温度下进行反应。

如果适宜加入的适合的稀释剂是所有的惰性极性有机溶剂，如醚类、酰胺类、腈类、砜类、亚砜类或卤代烃类如二氯甲烷。

优选的是使用二甲基亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺、二氯甲烷。

在优选的实施方式中，如果通过加入强脱质子剂如氢化钠或叔丁醇钾来制备式(I-1-a)至(I-8-a)化合物的烯醇盐，则不需要加入另外的酸结合剂。

如果采用酸结合剂，则是常规无机或有机碱，例如，氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、吡啶、三乙胺。

反应可以在常压下进行，或在加压下进行，优选是在常压下进行。后处理是通过常规方法进行。

本发明方法(N)的特征在于，如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下，使式(I-1-a)至(I-8-a)化合物在每一种情况下与式(XVIII)磷化合物反应。

在制备方法(N)中，在 -40°C 和 150°C 、优选 -10 和 110°C 之间，使1至2、优选1至1.3摩尔式(XVIII)磷化合物与1摩尔化合物(I-1-a)至(I-8-a)反应。

如果适宜加入的适合的溶剂是所有的惰性极性有机溶剂，如醚类、酰胺类、腈类、醇类、硫化物、砜类、亚砜类等。

优选使用乙腈、二甲亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺、二氯甲烷。

如果适宜加入的适合的酸结合剂是常规无机或有机碱如氢氧化物、碳酸盐或胺类。实例包括氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、吡啶、三乙胺。

反应可以在常压或在加压下进行，优选在常压下进行。后处理是通过有机化学的常规方法进行。终产物优选通过结晶、色谱纯化或通过所谓“初蒸馏”，即，在减压下去除挥发性组分，进行纯化。

方法(O)的特征在于，如果适宜在稀释剂存在下，使式(I-1-a)至(I-8-a)化合物与式(XIX)的金属氢氧化物或金属醇盐或式(XX)的胺反应。

对本发明方法(O)优选的稀释剂是醚类如四氢呋喃、二噁烷、乙醚，或醇类如甲醇、乙醇、异丙醇，也可以是水。

本发明方法(O)通常在常压下进行。

反应温度通常在 -20°C 至 100°C ，优选在 0°C 至 50°C 。

本发明方法(P)的特征在于，使式(I-1-a)至(I-8-a)化合物，(P- α)如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在催化剂存在下与式(XXI)的化合物反应，或(P- β)在如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下与式(XXII)化合物反应。

在制备方法(P- α)中，在 0 至 100°C 、优选在 20 至 50°C 下，大约1摩尔式(XXI)异氰酸酯与每摩尔式(I-1-a)至(I-8-a)起始原料反应。

如果适宜加入的适合的稀释剂是所有惰性有机溶剂，如醚类、酰

胺类、腈类、砜类、亚砜类。

如果适宜，可以加入催化剂来加速反应。非常优越的是，所采用的催化剂是有机锡化合物，如二月桂酸二丁基锡。反应优选是在常压进行。

在制备方法(P- β)中，在-20至150℃，优选在0至70℃下，使大约1摩尔式(XXII)氨基甲酰氯与每摩尔的式(I-1-a)至(I-8-a)起始原料反应。

如果适宜加入的适合的稀释剂是所有的惰性有机溶剂，如醚类、酰胺类、砜类、亚砜类或卤代烃类。

优选的是使用二甲基亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺或二氯甲烷。

在优选的实施方案中，如果式(I-1-a)至(I-8-a)的烯醇盐通过加入强脱质子剂(如，氢化钠或叔丁醇钾)形成，则不需要加入另外的酸结合剂。

如果采用酸结合剂，则它们是常规的无机或有机碱，例如，氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、三乙胺或吡啶。

反应可以在常压或加压下进行，且优选是在常压下进行。后处理是通过常规方法进行。

本发明活性化合物适合防治动物害虫，优选节肢动物和线虫，特别是出现在农业、森林、贮藏产品和材料保护以及卫生方面上的昆虫、螨。它们对正常的敏感和抗性种类和对所有或某些生长发育阶段有活性。上述害虫包括：

等足目，例如，潮虫(*Oniscus asellus*)、鼠妇(*Armadillidium vulgare*)和斑鼠妇(*Porcellio scaber*)。

倍足目，例如，具斑马陆(*Blaniulus guttulatus*)。

唇足目，例如，食果地蜈蚣(*Geophilus carpophagus*)和蚰蜒(*Scutigera spec*)。

综合目，例如，洁么蚰(*Scutigera immaculata*)。

缨尾目，例如，西洋衣鱼(*Lepisma saccharina*)。

弹尾目，例如，具棘跳虫(*Onychiurus armatus*)。

直翅目，例如，东方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、美洲大蠊(*Periplaneta americana*)、马德拉蜚蠊(*Leucophaea maderae*)、

德国小蠊 (*Blattella germanica*)、家蟋蟀 (*Acheta domesticus*)、蝼蛄属 (*Gryllotalpa* spp.)、热带飞蝗 (*Locusta migratoria migratorioides*)、殊种蚱蜢 (*Melanoplus differentialis*) 和沙漠蝗 (*Schistocerca gregaria*)。

革翅目, 例如, 欧洲球蝽 (*Forficula auricularia*)。

等翅目, 例如, 犀白蚁属 (*Reticulitermes* spp.)。

虱目, 例如, 美核桃根瘤蚜 (*Phylloxera vastatrix*)、瘿绵蚜属 (*Pemphigus* spp.)、体虱 (*Pediculus humanus corporis*)、血虱属 (*Haematopinus* spp.) 和颈虱属 (*Linognathus* spp.)。

食毛目, 例如, 啮毛虱属 (*Trichodectes* spp.) 和畜属虱 (*Damalinea* spp.)。

缨翅目, 例如, *Frankliniella occidentalis*、温室条蓟马 (*Hercinothrips femoralis*)、*Thrips palmi* 和棉蓟马 (*Thrips tabaci*)。

半翅目, 例如, 扁盾蝽属 (*Eurygaster* spp.)、中棉红蝽 (*Dysdercus intermedius*)、甜菜拟网蝽 (*Piesma quadrata*)、温带臭蝽 (*Cimex lectularius*)、长红猎蝽 (*Rhodnius prolixus*) 和锥蝽属 (*Triatoma* spp.)。

同翅目, 例如, 甘蓝粉虱 (*Aleurodes brassicae*)、甘薯粉虱 (*Bemisia tabaci*)、温室粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)、甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*)、茶藨隐瘤蚜 (*Cryptomyzus ribis*)、甜菜蚜 (*Aphis fabae*)、苹果蚜 (*Doralis pomi*)、苹果绵蚜 (*Eriosoma lanigerum*)、桃大尾蚜 (*Hyalopterus arundinis*)、麦长管蚜 (*Macrosiphum avenae*)、瘤额蚜属 (*Myzus* spp.)、忽布疣蚜 (*Phorodon humili*)、禾谷缢管蚜 (*Rhopalosiphum padi*)、微叶蝉属 (*Empoasca* spp.)、钝鼻叶蝉 (*Euscelis bilobatus*)、黑尾叶蝉 (*Nephotettix cincticeps*)、水土坚蚧 (*Lecanium corni*)、橄榄黑盔蚧 (*Saissetia oleae*)、灰稻虱 (*Laodelphax striatellus*)、稻褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*)、红肾圆盾蚧 (*Aonidiella aurantii*)、夹竹桃园蚧 (*Aspidiotus hederae*)、粉蚧属 (*Pseudococcus* spp.) 和木虱属 (*Psylla* spp.)。

鳞翅目, 例如, 棉红铃虫(*Pectinophora gossypiella*)、松天蛾(*Bupalus piniarius*)、冬尺蛾(*Cheimatobia brumata*)、苹细蛾(*Lithocolletis blancardella*)、苹果巢蛾(*Hyponomeuta padella*)、小菜蛾(*Plutella maculipennis*)、天幕毛虫(*Malacosoma neustris*)、黄毒蛾(*Euproctis chrysorrhoea*)、毒蛾属(*Lymantria* spp.)、棉潜蛾(*Bucculatrix thurberiella*)、桔潜叶蛾(*Phyllocnistis citrella*)、地老虎属(*Agrotis* spp.)、切根虫属(*Euxoa* spp.)、夜蛾属(*Feltia* spp.)、棉斑实蛾(*Earias insulana*)、棉铃虫属(*Heliothis* spp.)、甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua*)、甘蓝夜蛾(*Mamestra brassicae*)、小眼夜蛾(*Panolis flammea*)、斜纹夜蛾(*Prodenia litura*)、灰翅夜蛾属(*Spodoptera* spp.)、粉纹夜蛾(*Trichoplusia ni*)、苹囊蛾(*Carpocapsa pomonella*)、粉蝶属(*Pieris* spp.)、禾草螟属(*Chilo* spp.)、玉米螟(*Pyrausta nubilalis*)、地中海粉斑螟(*Ephestia kuehniella*)、大蜡螟(*Galleria mellonella*)、幕衣蛾(*Tineola bisselliella*)、袋衣蛾(*Tinea pellionella*)、褐织蛾(*Hofmannophila pseudospretella*)、亚麻黄卷蛾(*Cacoecia podana*)、*Capua reticulana*、枞色卷蛾(*Choristoneura fumiferana*)、葡萄果蠹蛾(*Clysia ambiguella*)、茶长卷蛾(*Homona magnanima*)和栎绿卷蛾(*Tortrix viridana*)。

鞘翅目, 例如, 具斑窃蠹(*Anobium punctatum*)、谷蠹(*Rhizopertha dominica*)、*Acanthoscelides obtectus*、大豆象(*Acanthoscelides obtectus*)、家天牛(*Hylotrupes bajulus*)、赤杨紫跳甲(*Agelasrtica alni*)、马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata*)、辣根猿叶甲(*Phaedon cochleariae*)、条叶甲属(*Diabrotica* spp.)、油菜蓝跳甲(*Psylliodes chrysocephala*)、墨西哥豆甲(*Epilachna varivestis*)、隐翅甲属(*Atomaria* spp.)、锯谷盗(*Oryzaephilus surinamensis*)、花象甲属(*Anthonomus* spp.)、米象属(*Sitophilus* spp.)、葡萄黑耳喙象(*Otiorrhynchus sulcatus*)、香蕉根象甲(*Cosmopolites sordidus*)、甘蓝芜象甲(*Ceuthorrhynchus assimilis*)、苜蓿叶象虫(*Hypera postica*)、皮蠹属(*Dermestes* spp.)、斑皮蠹属

(*Trogoderma* spp.)、圆皮蠹属(*Anthrenus* spp.)、毛蠹属(*Attagenus* spp.)、粉蠹属(*Lyctus* spp.)、油菜花露尾甲(*Meligethes aeneus*)、蛛甲属(*Ptinus* spp.)、金黄蛛甲(*Niptus hololeucus*)、裸蛛甲(*Gibbium psylloides*)、拟谷盗属(*Tribolium* spp.)、黄粉虫(*Tenebrio molitor*)、叩头虫属(*Agriotes* spp.)、宽胸叩头虫属(*Conoderus* spp.)、西方五月鳃角金龟(*Melolontha melolontha*)、马铃薯鳃角金龟(*Amphimallon sostitialis*)和褐新西兰肋翅鳃角金龟(*Costelytra zealandica*)。

膜翅目，例如，锯角叶蜂属(*Diprion* spp.)、叶蜂属(*Hoplocampa* spp.)、田蚁属(*Lasius* spp.)、小家蚁(*Monomorium pharaonis*)和胡蜂(*Vespa* spp.)。

双翅目，例如，伊蚊属(*Aedes* spp.)、按蚊属(*Anopheles* spp.)、库蚊属(*Culex* spp.)、黄猩猩果蝇(*Drosophila melanogaster*)、蝇属(*Musca* spp.)、厕蝇属(*Fannia* spp.)、红头丽蝇(*Callophora erythrocephala*)、绿蝇属(*Lucilia* spp.)、金蝇属(*Chrysomya* spp.)、疽蝇属(*Cuterebra* spp.)、胃蝇属(*Gastrophilus* spp.)、虱蝇属(*Hyppobosca* spp.)、*Liriomyza* spp.、螫蝇属(*Stomoxys* spp.)、狂蝇属(*Oestrus* spp.)、皮蝇属(*Hypoderma* spp.)、虻属(*Tabanus* spp.)、塘虱属(*Tannia* spp.)、花园毛蚊(*Bibio hortulanus*)、瑞典麦杆蝇(*Oscinella frit*)、草种蝇属(*Phorbia* spp.)、菠菜潜叶花蝇(*Pegomyia hyoscyami*)、地中海实蝇(*Ceratitis capitata*)、橄榄实蝇(*Dacus oleae*)和沼泽大蚊(*Tipula paludosa*)。

蚤目，例如，印鼠客蚤(*Xenopsylla cheopis*)、毛列蚤属(*Ceratophyllus* spp.)。

蛛形目，例如，蝎(*Scorpio maurus*)和毒寇蛛(*Latrodectus mactans*)。

蜱螨目，例如，粗脚粉螨(*Acarus siro*)、隐喙蜱属(*Argas* spp.)、钝喙蜱属(*Ornithodoros* spp.)、鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*)、茶瘿螨(*Eriophyes ribis*)、柑桔锈螨(*Phyllocoptruta oleivora*)、牛蜱属(*Boophilus* spp.)、扇头蜱属(*Rhipicephalus* spp.)、花蜱属(*Amblyomma* spp.)、玻眼蜱属

(Hyalomma spp.)、硬蜱属(Ixodes spp.)、瘧蟎属(Psoroptes spp.)、皮蟎属(Chorioptes spp.)、疥蟎属(Sarcoptes spp.)、跗线蟎属(Tarsonemus spp.)、苜蓿苔蟎(Bryobia praetiosa)、全爪蟎属(Panonychus spp.)和叶蟎属(Tetranychus spp.)。

本发明活性化合物的突出之处在于在叶和土壤施用后其强的杀虫和杀蟎活性。

它们可以特别成功地采用来防治损害植物的昆虫，例如防治辣根猿叶甲(Phaedon cochleariae)幼虫、黑尾叶蝉(Nephotettix cincticeps)幼虫或防治桃蚜(Myzus persicae)幼虫。

本发明活性化合物还可以用作脱叶剂、干燥剂、杀茎秆剂和特别是用作除草剂。所谓的杂草，就其最宽的范围而言，应理解为生长在该不该生长的地方的所有植物。本发明的物质是作为天生性除草剂或是选择性除草剂基本上取决于所用的量。

防治杂草所需的本发明活性化合物的剂量介于0.001至10kg/ha，优选介于0.005至5kg/ha之间。

本发明化合物可以与下列植物相关使用：

下列属的双子叶杂草：芥属、独行草属、猪殃殃属、繁缕属、母菊属、春黄菊属、牛膝属、藜属、苧麻属、千里光属、苋属、马齿苋属、苍耳属、旋花属、甘薯属、蓼属、田菁属、豚草属、蓟属、飞廉属、苦苣菜属、茄属、蔊菜属、节节草属、母草属、野芝麻属、婆婆纳属、苘麻属、刺酸模属、曼陀罗属、莖菜属、鮡瓣花属、罂粟属、矢车菊属、三叶草属、毛茛属和蒲公英属，

下列属的双子叶作物：棉属、大豆属、甜菜属、胡萝卜属、菜豆属、豌豆属、茄属、亚麻属、甘薯属、野豌豆属、烟草属、蕃茄属、花生属、芸苔属、莴苣属、黄瓜属和南瓜属，

下列属的单子叶杂草：稗属、狗尾草属、黍属、马唐、梯牧草属、早熟禾属、羊茅属、蟋蟀草属、臂形草属、黑麦草属、雀麦属、燕麦属、莎草属、高粱属、冰草属、狗牙根属、雨久花属、飘拂草属、慈菇属、荸荠属、蔗草属、雀稗属、鸭嘴草属、尖瓣花属、龙爪茅属、剪股颖属、看麦娘属和风草属，

下列属的单子叶作物：稻属、玉米属、小麦属、大麦属、燕麦属、黑麦属、高粱属、黍属、甘蔗属、凤梨属、天门冬属和葱属。

然而，本发明化合物的应用决不限于这些属，且也可以相同的方式延伸至其它植物。

取决于化合物的浓度，化合物适合于天生性防治杂草，例如工业地域和铁道线，以及有或无种植树林的道路和广场。同样，化合物可以用于防治多年生作物中的杂草，例如森林、装饰树林、果园、葡萄园、柑桔林、坚果园、蕉种植园、咖啡种植园、茶园、橡胶种植园、油棕榈种植园、可可种植园、软果林和啤酒花田、草场、草皮和牧场中的杂草，和选择性地防治一年生作物中的杂草。

本发明式(I)化合物特别适合于选择性地以芽前和芽后二种方式防治双子叶作物中的单子叶杂草。它们可以采用非常成功地防治例如棉花或糖用甜菜中的有害禾草。

活性化合物可以转化成常规的制剂，如溶液、乳剂、可湿性粉剂、悬浮剂、粉剂、喷粉剂、膏剂、水溶性粉剂、颗粒剂、悬浮乳剂、用活性化合物浸渍的天然或合成材料，以及包在聚合物中的微细胶囊。

这些型剂可以用已知的方式生产，例如，将活性化合物与扩充剂，即液体和/或与固体载体混合，并任选使用表面活性剂，即乳化剂和/或分散剂和/或起泡剂。

在用水作扩充剂的情况下，也可以用有机溶剂作助溶剂。作为液体溶剂，适合的主要有：芳族化合物，如二甲苯，甲苯或烷基苯，氯代芳族化合物或氯代脂肪烃，如氯代苯类、氯乙烯类或二氯甲烷，脂族烃，如环己烷或石蜡，例如矿物油馏份、矿物和植物油，醇类，如丁醇或乙二醇以及其醚和酯，酮类，如丙酮、甲乙酮、甲基异丁基酮或环己酮，强极性溶剂，如二甲基甲酰胺或二甲基亚砷，以及水。

适合的固体载体是：

例如铵盐和磨碎的天然矿物质如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、硅镁土、蒙脱石或硅藻土，和磨碎的合成矿物质，如高分散二氧化硅、矾土和硅酸盐；用于颗粒剂的固体载体适合的有：例如压碎并分级的天然矿物质如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石，以及有机和无机粉的合成颗粒，和如下有机物的颗粒：锯木屑、椰壳、玉米穗轴和烟茎；适合的乳化剂和/或起泡剂是：例如非离子和阴离子乳化剂，如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚，例如，烷基芳基聚乙二醇醚，烷基磺酸盐，烷基硫酸盐，芳基磺酸盐以及白蛋白水解产

物；适合的分散剂是：例如，木素亚硫酸废液和甲基纤维素。

制剂中可以使用粘合剂如羧甲基纤维素和粉状、颗粒或乳胶形式的天然和合成聚合物，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，和合成磷脂。其它的添加剂可以是矿物油和植物油。

也可能使用染料，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，和微量营养素如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

制剂中通常含有按重量计 0.1 至 95% 的活性化合物，优选 0.5 至 90%。

本发明活性化合物可以其商业上可行的制剂和由这些制剂制备的使用形式作为与如下的其它活性化合物的混合物存在：杀虫剂、引诱剂、杀菌剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、生长调节剂或除草剂。杀虫剂包括例如磷酸酯类、氨基甲酸酯、羧酸酯类、氯代烃类、苯基脲类、由微生物生产的物质，及其它。

混合物的特别有利的组分是例如下列：

杀真菌剂：

2-氨基丁烷、2-苯胺基-4-甲基-6-环丙基-嘧啶；2',6'-二溴-2-甲基-4'-三氟甲氧基-4'-三氟甲基-1,3-噻唑-5-甲酰苯胺；2,6-二氯-N-(4-三氟甲基苯甲基)苯甲酰胺；(E)-2-甲氧基亚氨基-N-甲基-2-(2-苯氧苯基)乙酰胺；8-羟基喹啉硫酸盐；(E)-2-{2-[6-(2-氟基-苯氧基)嘧啶-4-氧基]苯基}-3-甲氧基丙烯酸甲酯；(E)-甲氧基亚氨基[α -(邻甲苯氧基)-邻甲苯基]乙酸甲酯；2-苯基苯酚(OPP)、艾敌吗啉(alldimorph)、氯丙磷酸、氯丙磷酸钾、敌菌灵、戊环唑、苯霜灵、碘萎灵、苯菌灵、乐杀螨、联苯、双苯三唑醇、灭瘟素、糠菌唑、磺酸丁嘧啶、丁赛特、石硫合剂、敌菌丹、克菌丹、多菌灵、萎锈灵、甲基克杀螨、地茂散、氯化苦、百菌清、乙菌利、硫杂灵、霜脲氰、环唑醇、酯菌胺、防霉酚、苄氯三唑醇、抑菌灵、哒菌清、氯硝胺、乙霉威、噁醚唑、甲嘧醇、烯酰吗啉、烯唑醇、清螨普、二苯胺、吡菌硫、灭菌磷、二嗪农、多果定、腈菌酮、克菌散、氟环唑、乙嘧啶、氯唑灵、双氯苯嘧啶、苯氧唑、吡菌胺、种衣酯、拌种咯、苯锈啶、丁苯吗啉、乙酸三苯基锡、三苯羟基锡、福美铁、噻菌胺、

氯啉胺、咯菌清、氯氯菌核利、氯喹唑、氯硅唑、噻菌胺、氯酰胺、粉唑醇、灭菌丹、乙磷铝、乙磷钠、四氯苯酞、麦穗宁、呋霜灵、拌种胺、双胍辛、六氯苯、己唑醇、甲羟异噁唑、抑霉唑、酰胺唑、双胍辛醋酸盐、异稻瘟净、异菌脲、稻瘟灵、春日霉素、铜制剂(如氢氧化铜、环烷酸铜、碱式氯化铜、硫酸铜、氧化铜、喹啉酮和波尔多混合物)、双代混剂、代森锰锌、代森锰、噻菌胺、灭锈胺、甲霜灵、叶菌唑、噻菌威、担菌胺、代森联、噻菌胺、腈菌唑、福美镍、异丙消、氯苯嘧啶醇、甲呋酰胺、噁酰胺、oxamocarb、氧化萎锈灵、稻瘟酯、戊菌唑、戊菌隆、稻病磷、稻瘟酞、匹马菌素、啉啉宁、多氧霉素、烯丙异噁唑、咪鲜安、二甲菌核利、霜霉威、丙环唑、甲基代森锌、定菌磷、啉斑肟、噻霉胺、咯喹酮、五氯硝基苯、硫磺和硫制剂、戊唑醇、酞枯酸、四氯硝基苯、氯醚唑、噻菌灵、噻菌腈、甲基托布津、福美双、甲基立枯灵、对甲抑菌灵、三唑酮、三唑醇、唑菌嗪、杨菌胺、三环唑、环吗啉、氯菌唑、啉菌灵、灭菌唑、稻纹散、乙烯菌核利、代森锌、福美锌。

杀细菌剂:

拌棉酚、防霉酚、氯定、福美镍、春日霉素、异噻菌酮、呋喃羧酸、土霉素、烯丙异噁唑、链霉素、酞枯酸、硫酸铜和其它铜制剂。

杀虫剂 / 杀螨剂 / 杀线虫剂:

齐墩螨素、虫螨腈、乙酰甲胺磷、氯酯菊酯、棉铃威、涕灭威、甲体氯氯菊酯、双甲脒、阿维菌素(ivermectin)、AZ 60541、印楝素、乙基谷硫磷、谷硫磷、三唑锡、苏芸金杆菌、苯噁威、丙硫克百威、杀虫磺、乙体氯氯氯菊酯、联苯菊酯、丁苯威、溴醚菊酯(brofenprox)、溴硫磷、混戊威、噻嗪酮、丁酮威、丁基吡啶酮、硫线磷、西维因、克百威、三硫磷、丁硫克百威、巴丹、CGA 157 419、CGA 184 699、除线威、氯氧磷、毒虫畏、定虫隆、氯甲硫磷、毒死蜱、甲基毒死蜱、顺式苄呋菊酯、三氯氯氯菊酯、四螨嗪、杀螟腈、乙氯菊酯、氯氯氯菊酯、氯氯氯菊酯、三环锡、氯氯菊酯、灭蝇胺、溴氯菊酯、甲基内吸磷、内吸磷、异吸磷II、杀螨隆、地亚农、氯线磷、敌敌畏、dicliphos、百治磷、乙硫磷、伏虫脲、乐果、甲基毒虫畏、二噁硫磷、乙拌磷、克瘟散、emamectin、高氯戊菊酯、除蚜威、乙硫磷、醚菊酯、丙线磷、乙噻硫磷、克线磷、噻螨醚、螨完锡、

杀螟硫磷、仲丁威、苯硫威、双氧威、甲氧菊酯、fenpyrad、唑螨酯、倍硫磷、氟戊菊酯、氟虫腈、氟啶胺、氟螨脲、氟氟戊菊酯、氟虫脲、氟醚菊酯(flufenprox)、氟胺氟菊酯、地虫硫磷、安果、噻唑硫磷、溴醚菊酯(fubfenprox)、呋线威、六六六、庚虫磷、氟铃脲、噻螨酮、吡虫啉、异稻瘟净、氯唑磷、异丙胺磷、异丙威、噁唑磷、伊维菌素、 λ -三氟氯氟菊酯、虱螨脲、马拉硫磷、灭蚜硫磷、速灭磷、倍硫磷亚砷、蜗牛敌、虫螨畏、甲胺磷、甲噻硫磷、甲硫威、灭多威、速灭威、米尔倍菌素、久效磷、moxidectin、二溴磷、NC 184、啉虫脒、烯啶虫胺、氧乐果、草膦威、砒吸硫磷、异砒磷、对硫磷、甲基对硫磷、氯菊酯、稻丰散、甲拌磷、伏杀硫磷、亚胺硫磷、磷胺、辛硫磷、抗蚜威、甲基嘧啶硫磷、嘧啶硫磷、丙溴磷、甲丙威、丙虫威、残杀威、低毒硫磷、发果、pymetrozin、吡唑硫磷、苯哒嗪硫磷、反灭菊酯、除虫菊酯、哒螨酮、嘧螨醚、蚊蝇醚、啮硫磷、RH 5992、水杨硫磷、硫线磷、氟硅菊酯、治螟磷、甲丙硫磷、虫酰肼、吡螨胺、特丁嘧啶硫磷、伏虫隆、七氟菊酯、双硫磷、叔丁威、特丁甲拌磷、杀虫畏、thiafenox、硫双灭多威、己酮膦威、甲基乙拌磷、啮线磷、苏芸金菌素、四溴菊酯、苯赛螨、三唑磷、triazuron、敌百虫、杀虫隆、三叉威、完灭硫磷、二甲威、二甲苯威、YI 5301/5302、zetamethrin.

除草剂:

例如酰胺苯胺类如吡氟草胺和敌稗; 芳基羧酸类如二氯吡啶甲酸、麦草畏和毒草定; 芳氧羧酸类如 2,4-滴、2,4-滴丁酸、2,4-滴丙酸、氟草烟、2 甲 4 氯、2 甲 4 氯丙酸和绿草定; 芳氧基苯氧羧酸类如禾草灵、噁唑禾草灵、吡氟禾草灵、吡氟氯禾灵和啮禾灵; 吡嗪酮类如杀草敏和啮草伏; 氨基甲酸酯类如氟苯胺灵、甜菜安、甜菜宁和苯胺灵; 氯乙酰苯胺类如甲草胺、乙草胺、丁草胺、吡草胺、异丙草胺、丙草胺和毒草胺; 二硝基苯胺类如安磺灵、二甲戊乐灵和氟乐灵; 二苯醚类如三氟羧草醚、甲羧除草醚、乙羧氟草醚、氟黄胺草醚、halosafen、乳氟禾草灵和乙氧氟草醚; 脲类如绿麦隆、敌草隆、伏草隆、异丙隆、利谷隆和甲基苯噻隆; 羟胺类如禾草灭、烯草酮、噻草酮、稀禾定和膦草酮; 咪唑啉酮类如咪草烟、咪草酯、灭草烟和灭草啮; 腈类如溴苯腈、敌草腈和碘苯腈; 氧乙酰胺类如苯噻草胺; 磺

酰胺类如酰胺磺隆、苄嘧磺隆、氯嘧磺隆、绿磺隆、醚磺隆、甲磺隆、烟嘧磺隆、氯嘧磺隆、吡嘧磺隆、噻磺隆、醚苯磺隆和苯磺隆；硫代氨基甲酸酯类如丁草特、灭草特、燕麦敌、茵达灭、禾草畏、草达灭、苄草丹、杀草丹和野麦畏；三嗪类如莠去津、氰草津、西玛津、西草净、特丁净和特丁津；三嗪酮类如环嗪酮、苯嗪草酮和嗪草酮；其它除草剂如杀草强、吡草黄、灭草松、环庚草醚、异噁草酮、二氯吡啶酸、双苯唑快、氟硫草定、乙吡草黄、氟咯草酮、草铵膦、草甘膦、异亚砷草胺、吡草特、二氯喹啉酸、喹草酸、草硫膦和灭草环。

此外，本发明活性化合物可以以其商业上可行的制剂和以由这些制剂制备的使用形式与增效剂的混合物存在。增效剂是可以增加活性化合物活性，而所添加的增效剂本身无需有活性的化合物。

由商业上可行的制剂制备的使用形式中的活性化合物的含量可以在相当宽的范围内变化。使用形式的活性化合物浓度可以是按重量计 0.0000001 至 95% 的活性化合物，优选在按重量计 0.0001 至 1% 间。

化合物是以适合于使用形式的常规方式使用的。

当用来防治卫生害虫和贮藏产品的害虫时，活性化合物对木材和陶土具有显著残留作用和对石灰处理过的底物上的碱具有良好的稳定性。

本发明活性化合物不仅对植物、卫生和贮藏产品害虫有活性，而且在兽医方面，对动物寄生虫(体外寄生虫)如硬蜱、隐喙蜱科、疥螨、恙螨、(叮咬和吸吮)蝇、寄生蝇幼虫、毛虱、鸟虱和蚤有活性。这些寄生虫包括：

虱目，例如，血虱属(*Haematopinus* spp.)、顎虱属(*Linognathus* spp.)、虱属(*Pediculus* spp.)、阴虱属(*Phthirus* spp.)、盲虱属(*Solenoptes* spp.)。

食毛目及 amblycerina 和细角亚目(*Ischnocerina*)，例如，毛鸟虱属(*Trimenopon* spp.)、短角鸟虱属(*Menopon* spp.)、豆虱属(*Trinoton* spp.)、牛羽虱属(*Bovicola* spp.)、*Werneckiella* spp.、*Lepikentron* spp.、畜虱属(*Damalinae* spp.)、啮毛虱属(*Trichodectes* spp.)和猫虱属(*Felicola* spp.)。

双翅目及长角亚目和短角亚目，例如，伊蚊属(*Aedes* spp.)、

按蚊属(*Anopheles* spp.)、库蚊属(*Culex* spp.)、蚋属(*Simulium* spp.)、真蚋属(*Eusimulium* spp.)、白蛉属(*Phlebotomus* spp.)、卢蚊属(*Lutzomyia* spp.)、库蠓属(*Culicoides* spp.)、斑虻属(*Chrysops* spp.)、瘤虻属(*Hybomitra* spp.)、黄虻属(*Atylotus* spp.)、虻属(*Tabanus* spp.)、麻虻属(*Haematopota* spp.)、*Philipomyia* spp.、*Braula* spp.、蝇属(*Musca* spp.)、齿股蝇(*Hydrotaea* spp.)、螫蝇属(*Stomoxys* spp.)、血蝇属(*Haematobia* spp.)、*Morellia* spp.、厕蝇属(*Fannia* spp.)、舌蝇属(*Glossina* spp.)、丽蝇属(*Calliphora* spp.)、绿蝇属(*Lucilia* spp.)、金蝇属(*Chrysomyia* spp.)、肉蝇属(*Wohlfahrtia* spp.)、麻蝇属(*Sarcophaga* spp.)、狂蝇属(*Oestrus* spp.)、皮蝇属(*Hypoderma* spp.)、胃蝇属(*Gastrophilus* spp.)、虱蝇属(*Hippobosca* spp.)、婢蝇属(*lipoptena* spp.)和羊虱蝇属(*Melophagus* spp.)。

蚤目，例如，蚤属(*Pulex* spp.)、栉头蚤属(*Ctenocephalides* spp.)、鼠客蚤属(*Xenopsylla* spp.)和毛列蚤属(*Ceratophyllus* spp.)。

半翅目，例如，臭虫属(*Cimex* spp.)、锥蝽属(*Triatoma* spp.)、红腹猎蝽属(*Rhodnius* spp.)和全圆蝽属(*Panstrongylus* spp.)。

蜚蠊目，例如，东方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、美洲大蠊(*Periplaneta americana*)、德国小蠊(*Blattella germanica*)和棕带蠊属(*Suppella* spp.)。

螨亚纲及后气亚目(Metastigmata)和中气亚目(mesostigmata)，例如，隐喙蜱属(*Argas* spp.)、钝喙蜱属(*Ornithodoros* spp.)、残喙蜱属(*Otobius* spp.)、硬蜱属(*Ixodes* spp.)、花蜱属(*Amblyomma* spp.)、牛蜱属(*Boophilus* spp.)、革蜱属(*Dermacentor* spp.)、血蜱属(*Haemaphysalis* spp.)、眼玻璃蜱属(*Hyalomma* spp.)、扇头蜱属(*Rhipicephalus* spp.)、刺皮螨属(*Dermanyssus* spp.)、刺利螨属(*Raillietia* spp.)、肺刺螨属(*Pneumonyssus* spp.)、胸口螨属(*Sternostoma* spp.)和瓦螨属(*Varroa* spp.)。

Actinedida(前气孔亚目)和粉螨目(无气孔亚目),例如,蜂盾螨属(*Acarapis* spp.)、姬螯螨属(*Cheyletiella* spp.)、禽螯螨属(*Ornithocheyletia* spp.)、肉螨属(*Myobia* spp.)、疮螨属(*Psorergates* spp.)、蠕形属(*Demodex* spp.)、恙螨属(*Trombicula* spp.)、牦螨属(*Listrophorus* spp.)、粉螨属(*Acarus* spp.)、食酪螨属(*Tyrophagus* spp.)、嗜木螨属(*Caloglyphus* spp.)、颈下螨属(*Hypodectes* spp.)、翅螨属(*Pterolichus* spp.)、瘰螨属(*Psoroptes* spp.)、痒螨属(*Chorioptes* spp.)、耳癬螨属(*Otodectes* spp.)、疥螨属(*Sarcoptes* spp.)、痂螨属(*Notoedres* spp.)、疣螨属(*Knemidocoptes* spp.)、胞螨属(*Cytodites* spp.)和皮膜螨属(*Laminosioptes* spp.)。

本发明式(I)活性化合物也适合防治侵害如下动物的节肢动物:牲畜例如牛、绵羊、山羊、马、猪、猴、骆驼、水牛、兔、鸡、火鸡、鸭、鹅、蜜蜂,其它家养动物,如狗、猫、笼养鸟、水箱中的鱼,和所谓的实验动物,例如仓鼠、豚鼠、大鼠和小鼠。通过防治这些节肢动物,旨在使死亡和产量(如肉、乳、毛、皮、蛋、蜜等)降低的情况减少。这样,通过使用本发明活性化合物,使更经济简单的动物管理成为可能。

本发明活性化合物可以使用在兽医方面,使用是以已知的方式,通过外部施用,例如以片剂、胶囊、药水、兽用顿服剂、颗粒剂、膏剂、大丸剂、食入法、栓剂的方式,通过非肠道施药,例如注射(肌肉内、皮下、静脉内、腹腔内等)、植入,经鼻施用,经皮施用,例如通过沐浴或浸蘸、喷雾、浇泼、点涂、洗刷、喷粉的方式,以及借助含有活性化合物的成形物件,如颈环、耳标、尾牌、腿箍、笼头、标记设备等。

当给药于畜禽、家养动物等时,式(I)的活性化合物可以以制剂的形式(例如粉剂、乳剂、悬浮剂)的使用,所述的制剂中含有按重量计1至80%的活性化合物,该制剂可以直接施用或稀释100至10000倍后施用,或者它们可以以化学浴的形式使用。

然而,现已发现,本发明式(I)化合物对破坏工业材料的昆虫具有强的杀虫作用。

可以列举且是优选的昆虫是下列，但不限于这些昆虫：

甲虫如

北美家天牛 (*Hylotrupes bajulus*)、长毛天牛 (*Chlorophorus pilosis*)、具斑窃蠹 (*Anobium punctatum*)、报死窃蠹 (*Xestobium rufovillosum*)、梳角细脉窃蠹 (*Ptilinus pecticornis*)、*Dendrobium pertinex*、松窃蠹 (*Ernobium mollis*)、*Priobium carpini*、褐粉蠹 (*Lyctus brunneus*)、非洲粉蠹 (*Lyctus africanus*)、南方粉蠹 (*Lyctus planicollis*)、桴粉蠹 (*Lyctus linesris*)、柔毛粉蠹 (*Lyctus pubescens*)、*Trogoxylon aequale*、鳞毛粉蠹 (*Minthes rugicollis*)、材小蠹 (*Xyleborus spec.*)、*Tryptodendron spec.*、咖啡黑长蠹 (*Apate monachus*)、榭长蠹 (*Bostyrchus capucins*)、暗褐长蠹 (*Heterobostrychus brunneus*)、长蠹属 (*Sinoxylon spec.*)和竹长蠹 (*Dinoderus minutus*)。

革翅目，如

小钢青树蜂 (*Sirex juvencus*)、大树蜂 (*Urocerus gigas*)、*U. gigas taignus*、*U. augur*。

白蚁，如

木白蚁 (*Kaloterme flavicollis*)、麻头堆砂白蚁 (*Cryptoterme brevis*)、灰点异白蚁 (*Heteroterme indicola*)、黄胸散白蚁 (*Reticuliterme flavipes*)、*Reticuliterme santonecsis*、避光散白蚁 (*Reticuliterme lucifugus*)、达尔文澳白蚁 (*Mastoterme darwiniensis*)、湿木白蚁 (*Zootermopsis nevadensis*)和家白蚁 (*Coptoterme formosanus*)。

衣鱼

如西洋衣鱼 (*Lepisma saccharina*)。

在本文中，工业材料应理解为无生命的材料如优选的是聚合物、胶水、粘性材料、纸和板、皮革、木材和木制品和漆。

木材和木制品是非常特别优选的受保护而使之不被昆虫侵害的材料。

可以用本发明的药剂或含有之的组合物保护的木材和衍生的木

制品应理解为有下列含意,例如,建筑木料、木梁、铁道枕木、桥梁组件、船用跳板、木制车辆、板箱、模板、包装箱、电线杆、木质矿道顶木、木制的门窗、胶合板、碎料板、木工的制品、或通常用在建筑或细木工中的木制品。

本发明活性化合物可以以其原样、以其浓缩物或通常的常规制剂使用。所述的常规制剂是例如可湿性粉剂、颗粒剂、溶液、悬浮剂、乳剂或膏剂。

上述制剂可以以本身已知的方式制备,例如通过将活性化合物与至少一种溶剂或稀释剂、乳化剂、分散剂和/或粘合剂或固定剂、防水剂、(如果需要)脱水剂和 UV 稳定剂和(如果需要)着色剂和染料和其它加工辅助剂混合。

用于保护木材和木制品的杀虫组合物或浓缩物包含浓度为按重量计 0.0001 至 95%,特别是按重量计 0.001 至 60% 的活性化合物。

所采用的组合物或浓缩物的量取决于昆虫的种类和密度,以及介质。所用最佳量可以在每种情况下由一系列试验来确定。然而,一般而言,以所要保护的材料为基准,采用按重量计 0.0001 至 20%,优选按重量计 0.001 至 10% 的活性化合物已足矣。

所用的溶剂和/或稀释剂是有机化学溶剂或溶剂混合物和/或低挥发性的油性或油样有机化学溶剂或溶剂混合物和/或极性有机化学溶剂或溶剂混合物和/或水,且如果适宜是乳化剂和/或润湿剂。

优选采用的有机化学溶剂是油性或油样溶剂,所述的溶剂具有大于 35 的挥发度和高于 30℃ 的闪点,优选高于 45℃。用作这种油性或油样溶剂的物质是低挥发性的,且不溶于水,这类物质适合的有矿物油或其芳族馏份或是含有矿物油的溶剂混合物,优选是石油溶剂、石油和/或烷基苯。

使用沸程为 170 到 220℃ 的矿物油、沸程为 170 到 220℃ 的石油溶剂、沸程为 250 到 350℃ 的砵子油、沸程为 160 到 280℃ 的石油或松节油精是有利的。

在优选的实施方案中,所用的物质是沸程为 180 至 210℃ 的液体脂族烃或沸程为 180 至 220℃ 的脂族和芳族烃的高沸点混合物和/或砵子油和/或单氯萘,优选 α -单氯萘。

挥发度高于 35 且闪点高于 30℃,优选高于 45℃ 的低挥发性有机

油性或油样溶剂，可以部分地由低或中挥发性的有机化学溶剂置换，其前提条件是，溶剂混合物也具有高于 35 的挥发度且闪点高于 30℃，优选高于 45℃，且杀虫剂/杀真菌剂混合物在此溶剂混合物中是可溶的或可乳化的。

在优选的实施方案中，部分有机化学溶剂或溶剂混合物被脂族极性有机化学溶剂或溶剂混合物置换。优选采用的物质是含有羟基和/或酯和/或醚基团的脂族有机化学溶剂，例如乙二醇醚、酯类等。

在本发明范围内使用的有机化学粘合剂是本身已知的粘合干性油和/或合成树脂，它们可以用水稀释和/或在所采用的有机化学溶剂中是可溶的、可分散的或可乳化的，特别是那些由如下组成，或包含如下成分的粘合剂：丙烯酸树脂、乙烯基树脂，例如聚乙酸乙烯酯、聚酯树脂、缩聚或加聚树脂、聚氨酯树脂、醇酸树脂或改性的醇酸树脂、苯酚树脂、烃类树脂如茛-香豆酮树脂、硅氧烷树脂、干性植物油和/或干性油和/或以天然和/或合成树脂为基础的物理干性粘合剂。

用作粘合剂合成树脂可以以乳液、分散液或溶液的形式使用。沥青或沥青状物质也可以用作粘合剂的物质，其量至多为按重量计 10%。此外，可以采用特别是着色剂、染料、防水剂、遮味剂和抑制剂或抗腐蚀剂。

根据本发明，组合物或浓缩物优选含有至少一种醇酸树脂或改性醇酸树脂和/或干性植物油作为粘合剂。根据本发明所优选采用的物质是油含量超过按重量计 45%，优选 50 至 68% 的醇酸树脂。

所有的或部分上述粘合剂可以由固定剂(混合物)或增塑剂(混合物)置换。这些添加剂是旨在防止活性化合物挥发和结晶或沉淀。它们优选置换 0.01 至 30% 的粘合剂(以所用的粘合剂的 100% 为基准)。

增塑剂来自属于下列化学类的物质：邻苯二甲酸酯类，如邻苯二甲酸二丁酯、邻苯二甲酸二辛酯或邻苯二甲酸苄基丁基酯，磷酸酯类，如磷酸三丁酯，己二酸酯类，如二(2-乙基己基)己二酸酯，硬脂酸酯，如硬脂酸丁酯或硬脂酸戊酯，油酸酯类，如油酸丁酯，甘油醚类或高分子量乙二醇醚类、甘油酯类和对甲苯磺酸酯类。

固定剂化学上基于聚乙烯烷基醚类如聚乙烯甲基醚，或酮类如二

苯甲酮或亚乙基二苯甲酮。

特别适合的溶剂或稀释剂也可以是水，如果适宜是水与一或多种上述有机化学溶剂或稀释剂、乳化剂和分散剂的混合物。

特别有效的木材保护通过工业规模的浸渍工艺，例如真空、双真空或压力工艺的方式获得。

如果适宜，直接可用的组合物还可以包含其它杀虫剂和(如果适宜)也可以有一或多种杀真菌剂。

可能混合于其中的另外的适合组分优选是 WO 94/29 268 中提到的杀虫剂和杀真菌剂。在上述文献中提到的化合物明确地说是本发明申请的一部分。

可以非常特别优选地混合于其中的组分是杀虫剂如毒死蜱、辛硫磷、氟硅菊酯、氟氯氰菊酯、甲体氯氰菊酯、氯氰菊酯、溴氰菊酯、氯菊酯、吡虫啉、啉虫脒、氟虫脲、氟铃脲和杀虫隆，以及杀真菌剂如氟环唑、己唑醇、戊环醇、丙环唑、戊唑醇、环唑醇、叶菌唑、抑霉唑、苯氟磺胺、甲苯氟磺胺、3-碘代-2-丙炔基丁基氨基甲酸酯、N-辛基-异噻唑啉-3-酮和 4,5-二氯-N-辛基异噻唑啉-3-酮。

因此，本申请还提供了杀虫剂和/或除草剂，其特征在于，它们含有至少一种本发明的式(I)化合物。

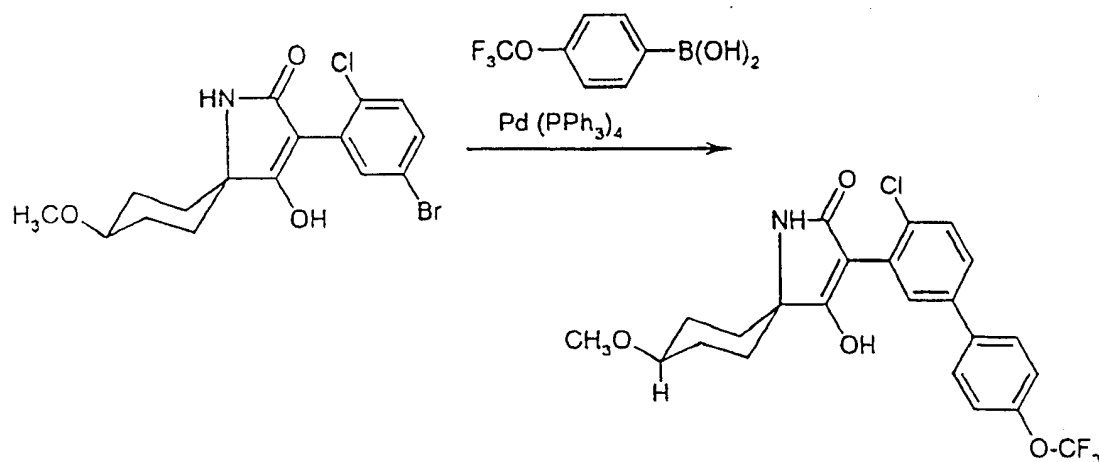
本申请还提供了本发明的式(I)化合物在作物保护、家居方面、卫生方面和贮存产品的保护上防治有害生物的应用。

本申请还提供了在作物保护、家居方面、卫生方面和贮存产品的保护上防治有害生物的方法，其特征在于，使本发明的的式(I)化合物作用于有害生物和/或其栖生地。

本申请还提供了制备杀虫剂和/或除草剂的方法，其特征在于，将本发明的式(I)化合物与扩充剂和/或表面活性剂混合。

本发明活性化合物的制备和应用通过参见下列实施例说明。

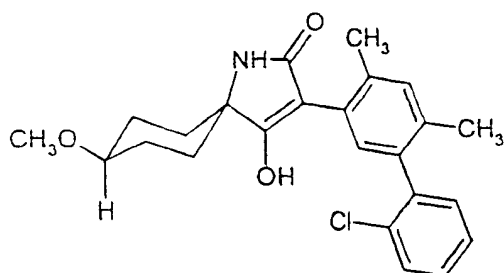
实施例(I-1a-1)



将 1.93g 上述溴化合物在 20ml 1,2-二甲氧基乙烷中在 20℃ 与 1.6g 4-三氟甲氧基苯基硼酸和 0.92g 四(三苯基膦)钯混合, 将混合物在 20℃ 下搅拌 15 分钟, 进入 15ml 20% 的碳酸钠溶液并在 80℃ 下搅拌一天。将溶液过滤, 用乙酸乙酯萃取。水相在 0-10℃ 下用浓盐酸酸化, 真空下浓缩至干, 残余物用二氯甲烷/乙酸乙酯 3:1 为移动相进行硅胶层析。

产量 0.40g (理论量的 17%), m. p. 143℃。

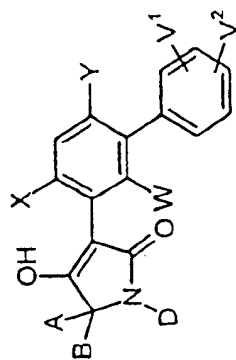
实施例 (I-1a-14)



在 80℃ 向在 7ml 无水二甲基甲酰胺中的 2.6g 叔丁醇钾中滴加在 9ml 无水 DMF 中的 4.42g 实施例 (II-10) 的化合物, 并在此温度下搅拌直到反应结束 (用薄层层析监测)。冷却后, 加入 90ml 冰水, 在 0-10℃ 下用浓盐酸酸化至 pH2。吸滤, 用冰水洗涤, 干燥并与甲基叔丁基醚 (MTBE) / 正己烷一起煮沸。

产量 2.81g (理论量的 68%), m. p. 204℃。

通过实施例 I-1-a-1 和 I-1-a-14 并通过制备式 I-1-a 化合物的一般描述, 制备下列化合物:

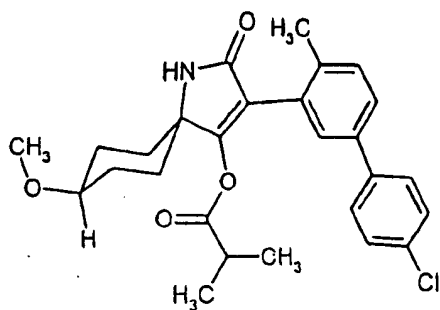


实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	D	A	B	m.p. (°C)	异构体
I-1-a-2*	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-3*	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-4*	CH ₃	OCH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-5*	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-6*	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-7*	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		>250	-
I-1-a-8*	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		>240	-
I-1-a-9*	H	Cl	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CH-OCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-10*	H	Cl	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-11*	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-12*	H	Cl	OCH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-13*	H	Cl	OCH ₃	H	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		134	β

式I-a化合物表格(续)

实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	D	A	B	m.p. (°C)	异构体
I-1-a-14	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		204	β
I-1-a-15	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		156	-
I-1-a-16*	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		185	β
I-1-a-17	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		>245	β
I-1-a-18	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₃	CH ₃	222	-
I-1-a-19	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		185	β
I-1-a-20	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		>250	-
I-1-a-21	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		>240	-
I-1-a-22	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		>240	-
I-1-a-23	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		208	β
I-1-a-24	H	C ₂ H ₅	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		138	β
I-1-a-25	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		238	β
I-1-a-26	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		>250	-
I-1-a-27	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		>235	-

*通过实施例I-1-a-1方法经由Suzuki偶联制备

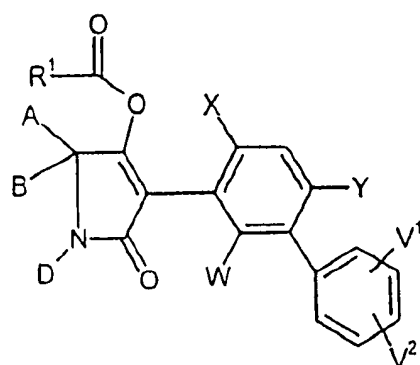
实施例 I-1-b-1

在回流下, 将 0.4ml 异丁酰氯加入到在 30ml 乙酸乙酯(EA)中的 1g 实施例(I-1-a-16)化合物和 0.5ml 三乙胺中, 并将混合物搅拌直到反应结束(用 TLC 监视)。将混合物浓缩并通过硅胶色谱纯化。

移动相: 二氯甲烷/EA 10/1

产量: 0.15g (理论量的 11%), m. p. 201℃.

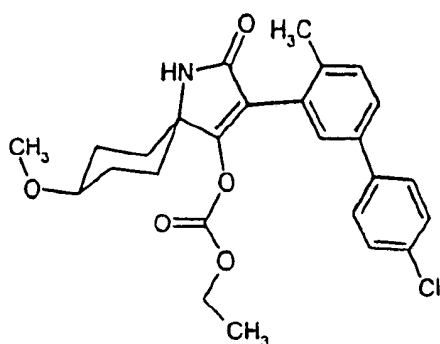
通过实施例(I-1-b-1)方法和制备式(I-1-b)化合物的一般方法, 制备下列化合物:



(I-1-b)

实施例 序号	W	X	Y	V ¹	V ²	D	A	B	R ¹	m.p. (°C)	异构体
I-1- b-2	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	>230	β

实施例 I-1-c-1

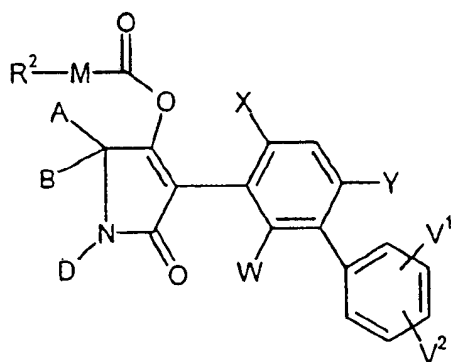


在 0℃ 下，将 0.35g 氯甲酸乙酯加入在 30ml 二氯甲烷中的 1g 实施例 (I-1-a-16) 化合物和 0.5ml 三乙胺中，并将混合物在 20℃ 下搅拌一天。将混合物浓缩，并将残余物通过硅胶色谱纯化。

移动相：二氯甲烷/EA 10/1

产量：0.12g, m. p. 194℃.

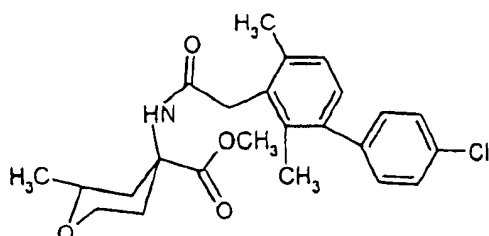
通过实施例 (I-1-c-1) 方法，并根据制备式 (I-1-c) 化合物的一般方法，制备下列化合物



(I-1-c)

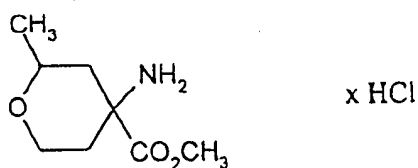
实施例 序号	W	X	Y	V ¹	V ²	D	A	B	M	R ²	m.p. (°C)	异构体
I-1- c-2	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	187	β
I-1- c-3	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		O	C ₂ H ₅	>240	-
I-1- c-4	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	i-C ₄ H ₉	168	β
I-1- c-5	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	CH ₃	CH ₃	O	C ₂ H ₅	149	-

实施例 II-1



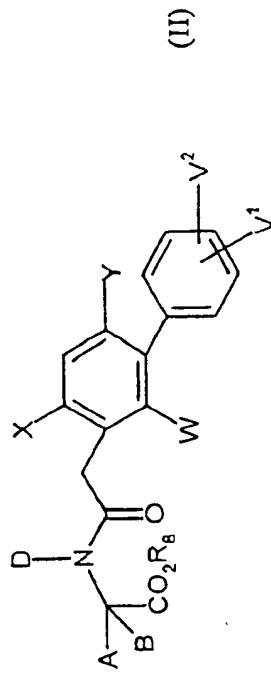
将 5g 实施例 (XXVII-5) 化合物和 7.6ml 亚硫酰氯在 80℃ 下加热，直至不在产生气体。去除过量的亚硫酰氯，并将残余物用 20ml 乙腈消化(溶液 1)。

先将 4.61g 下式化合物



加入到 20ml 乙腈中，加入 6.1g 磨碎的碳酸钾，在 0-10℃ 下滴加入溶液 1，并将混合物在室温下搅拌 1 小时。将混合物倒入 250ml 冰水中，并用二氯甲烷萃取，并将萃取液用 0.5N HCl 洗涤并浓缩。残余物经硅胶色谱(移动相为二氯甲烷/EA 3/1)，产量 5g，m. p.: 91℃。

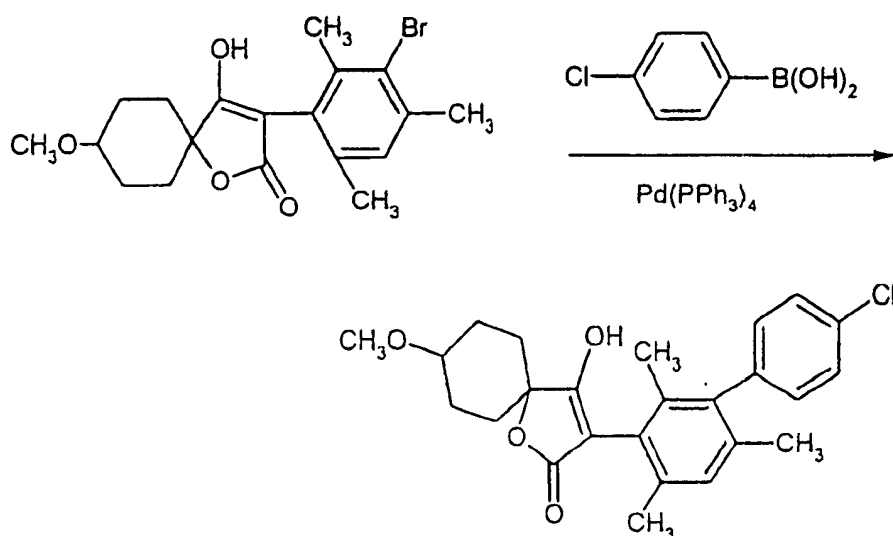
通过实施例 II-1 的方法，并根据制备式 (II) 化合物的一般程序，获得下列式 (II) 的实施例



实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	D	A	B	R ⁸	m.p. (°C)	异构体
II-2	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	125	-
II-3	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	76	β
II-4	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	179	-
II-5	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	186	β
II-6	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	169	-
II-7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	194	β
II-8	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	123	-
II-9	H	C ₂ H ₅	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	109	β
II-10	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	121	β

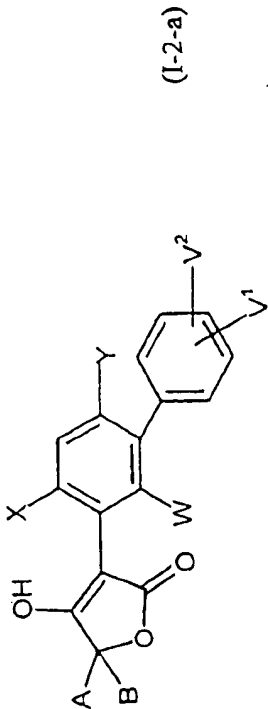
式(II)化合物的表格(续)

实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	D	A	B	R ⁸	m.p. (°C)	异构体
II-11	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	165	-
II-12	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	139	β
II-13	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	185	-
II-14	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	145	β
II-15	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	154	-
II-16	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	76	β
II-17	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	137	-
II-18	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	166	-

实施例 (I-2-a-1)

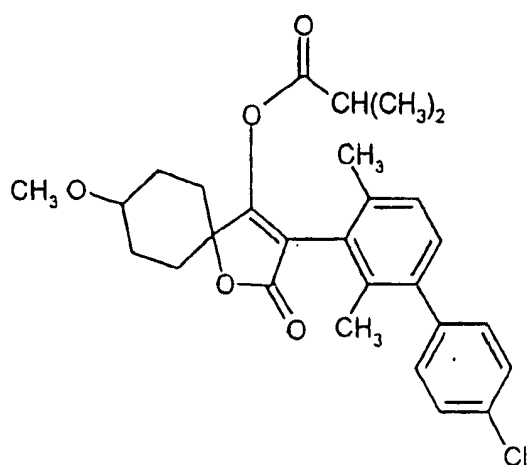
将 19.5ml 浓度 20% 的碳酸钠溶液加入到 20ml 二甲氧基乙烷中的 W0 97/36868 实施例获得的 1.55g 上述溴化合物、0.73g 4-氯苯基硼酸和 0.27g 四(三苯基膦)钯, 并将混合物在 80℃ 下搅拌 4 小时. 混合物用 1N NaOH 混合, 并用乙醚萃取二次. 将碱相过滤, 并使用稀盐酸酸化. 将混合物抽吸过滤并干燥. 产量 0.36g, m. p. 260-263℃.

通过实施例 I-2-a-1 的方法, 并根据制备式 (I-2-a) 化合物的程序, 获得下列式 (I-2-a) 的实施例.



实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	m.p. (°C)
I-2-a-2	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		243-245
I-2-a-3	H	Cl	H	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	I)	

1) ¹H NMR (300 MHz, d₆-DMSO): δ = 3.27, 3.29 (2s, 3H, OCH₃), 7.51-7.71 (m, 7H, ArH) 12.6 (brd, 1H, OH).

实施例 I-2-b-1

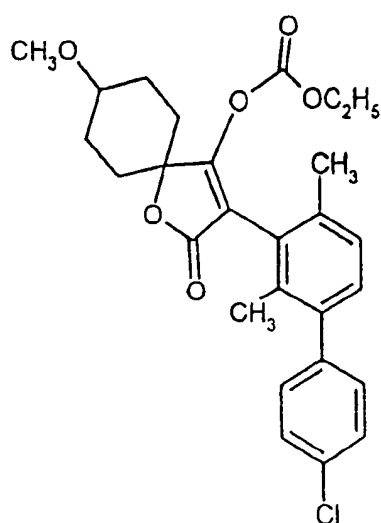
5 先将 0.125g (0.3mmol) 化合物 I-2-a-2 加入到无水二氯甲烷中，之后与 0.04g (0.36mmol) 三乙胺混合，并在 0-10℃ 下滴加入 0.04g (0.36mmol) 异丁酰氯。将混合物搅拌过夜，随后用浓度 10% 的柠檬酸洗涤一次，用浓度 10% 的碳酸钠水溶液洗涤一次，并将有机相干燥和浓缩。

产量：0.1g 油。

10

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ = 2.06, 2.07 (2s, 3H, Ar CH_3), 2.24, 2.25 (2s, 3H, Ar CH_3), 2.61 (m, 1H, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$), 3.35, 3.40 (2s, 3H, OCH_3), 7.09 (s, 2H, ArH), 7.16, 7.19 (AA', BB', 1H, Ar-H), 7.35, 7.37 (AA', BB', 2H, ArH).

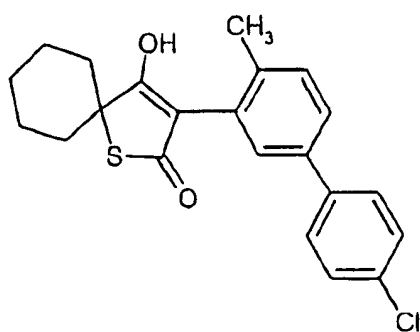
实施例 I-2-c-1



通过实施例 I-2-b-1 的方法，通过使实施例 I-2-a-2 化合物与氯甲酸乙酯反应制备。油。

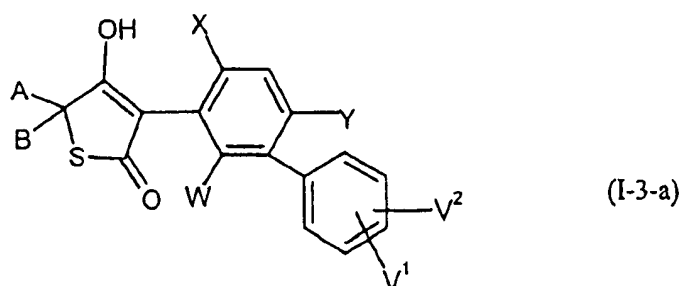
^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ = 1.10, (t, 3H, O- CH_2CH_3), 2.08, (2s, 3H, Ar CH_3), 2.24, 2.25 (2s, 3H, Ar CH_3), 3.36, 3.40 (2s, 3H, OCH_3), 7.11 (2s, 2H, ArH), 7.18, 7.21 (AA', BB', 2H, ArH), 7.35, 7.38 (AA', BB', 2H, ArH).

实施例 I-3-a-1



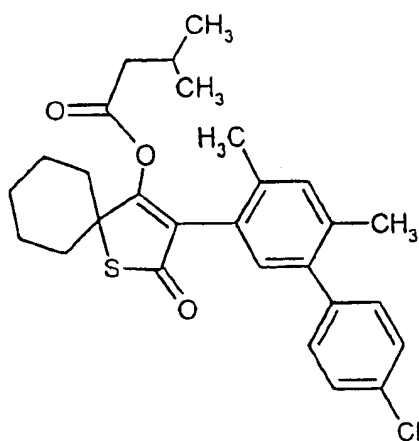
将 44g 实施例 IV-1 化合物和 92ml 三氯乙酸在 210ml 甲苯中加热回流过夜。将混合物浓缩，并将残余物用 600ml 水和 200ml MTBE 消化。通过加入 NaOH 将 pH 调节到 14，混合物用 MTBE 萃取二次。水相滴加到 1 升 1N HCl 中。将混合物搅拌 2 小时，用二氯甲烷萃取并浓缩。纯化时，将残余物用大约 200ml MTBE/环己烷 8/1 搅拌，抽吸过滤并干燥。产量：5.9g, m. p. 232-235 $^{\circ}\text{C}$ 。

通过实施例 (I-3a-1) 的方法和/或根据制备式 (I-3-a) 化合物的一般程序, 获得下列化合物



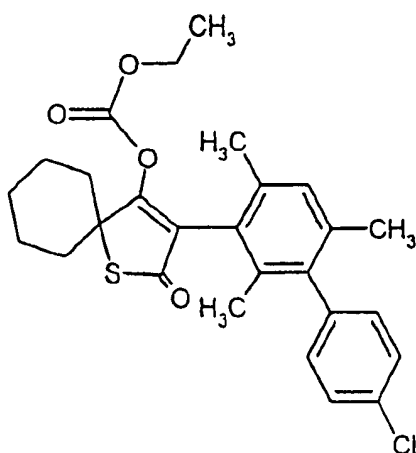
实施例 序号	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	m.p. (°C)
I-3-a-2	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₅ -		245-247
I-3-a-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₅ -		248-250

实施例 I-3-b-1



通过实施例 I-2-b-1 的方法, 使实施例 I-3-a-2 与异戊酰氯反应而制备。

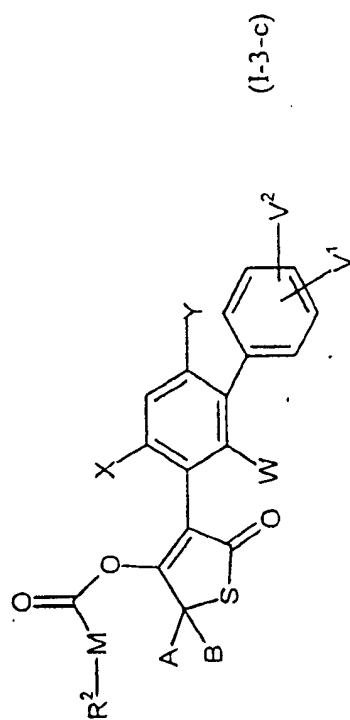
¹H NMR (400 MHz, d₆-DMSO): δ=0.9 (d, 6H, CH-CH₃); 1.2-2.0 (m, 10H, 环己基 -H); 2.1, 2.2 (s, 6H, 2xArCH₃); 6.85-7.5 (m, 6H, ArH) ppm.

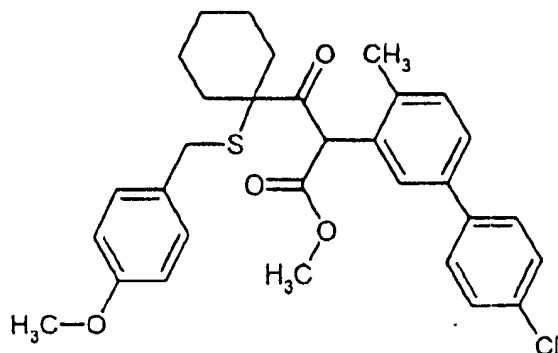
实施例 I-3-c-1

通过实施例 I-2-c-1 的方法, 使实施例 I-3-a-3 与氯甲酸乙酯反应而制备。油。

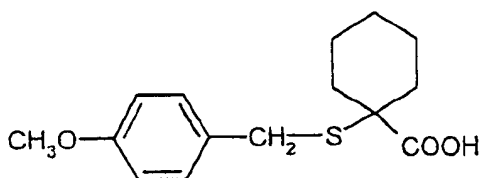
^1H NMR (400 MHz, d_6 -DMSO): $\delta=0.95$ (t, 3H, CH_2CH_3); 1.3-1.9 (m, 10H, 环己基 -H); 1.9 (s, 3H, ArCH_3); 2.1 (s, 6H, 2 x Ar-CH_3); 4.0 (q, 2H, OCH_2); 7.0-7.5 (m, 5H, Ar-H) ppm.

通过实施例 (I-3-c-1) 的方法和/或根据制备式 (I-3-c) 化合物的一般程序, 获得下列化合物



实施例 IV-1

A: 将 15g (53.5mmol) 下式化合物

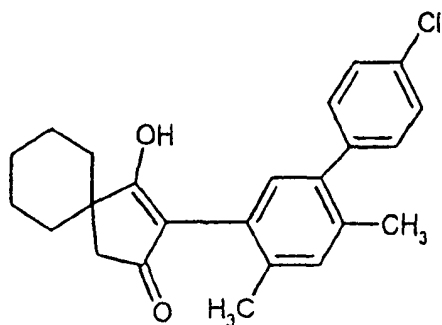


使用 9.63g (80.3mmol) 亚硫酰氯用常规方式转化成相应的酰氯, 并溶解于 30ml 四氢呋喃 (THF) 中。

B: 在 0℃ 下, 将 27g (87.5mmol) 实施例 XXXII-2 化合物滴加入到在 100ml THF 中的 45.8 ml (96.3mmol, 1.1 eq) 二异丙基氨基锂 (LDA) 溶液中, 将混合物在此温度下搅拌 30 分钟, 将加入上述 A 中制备的溶液。无需冷却, 继续搅拌 1 小时。之后滴加入 300ml MTBE 和几滴水, 混合物用每次 300ml 浓度 10% 的 NH_4Cl 溶液洗涤二次, 并浓缩。产量 44g。油。

^1H NMR (400 MHz, d_6 -DMSO): δ =1.2-2.0 (m, 10H, 环己基 -H); 2.25 (s, 3H, Ar- CH_3); 3.1 (dd, 2H, SCH_2); 3.6-3.7 (s, 6H, 2xOCH $_3$); 6.7-7.7 (m, 12H, Ar-H) ppm.

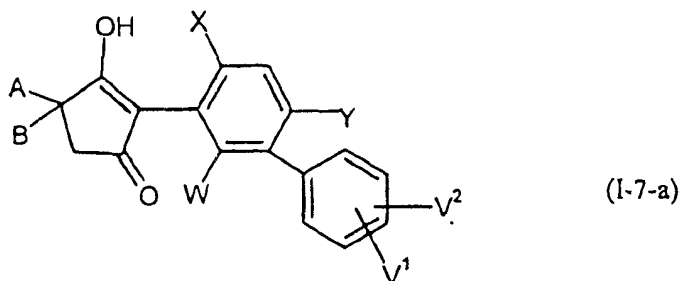
实施例 I-7-a-1



先将 5.3g (12.8mmol) 实施例 X-1 化合物加入到 20mlDMF 中, 与 2.2g (19.2mmol, 1.5eq) 叔丁醇钾混合, 并在 80℃ 下加热 1 小时 (用 TLC 监测)。

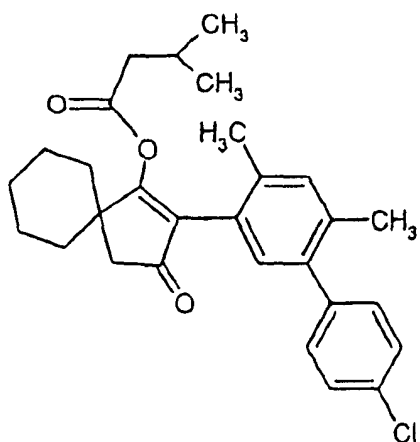
之后将混合物缓慢加入到大约 0.6 升 1N HCl (在冷却下) 中, 抽吸过滤并干燥。产量 4.85g, m. p. 224-226℃。

通过实施例 (I-7-a-1) 的方法和/或根据制备式 (I-7-a) 化合物的一般程序, 获得下列化合物



实施例 序号	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	m.p. (°C)
I-7-a-2	H	CH ₃	H	4-Cl	H	-(CH ₂) ₅ -		223-224
I-7-a-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₅ -		>250

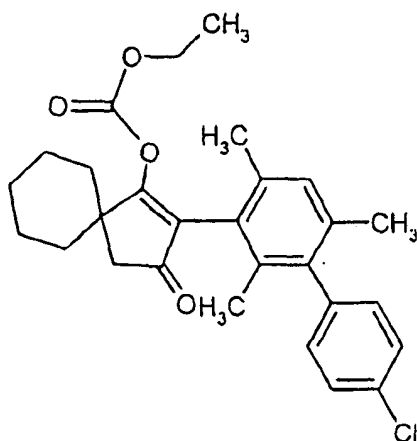
实施例 I-7-b-1



通过实施例 (I-2-b-1) 的方法, 通过使实施例 (I-7-a-1) 化合物与异戊酰氯反应而制备。产量 1.26g 油。

^1H NMR (400 MHz, d_6 -DMSO): $\delta=0.95$ (d, 6H, $2\times\text{CH}-\text{CH}_3$); 1.2-1.8 (m, 10H, 环己基 -H); 2.1, 2.2 (s, 6H, $2\times\text{Ar}-\text{CH}_3$); 6.8-7.5 (m, 6H, Ar-H) ppm.

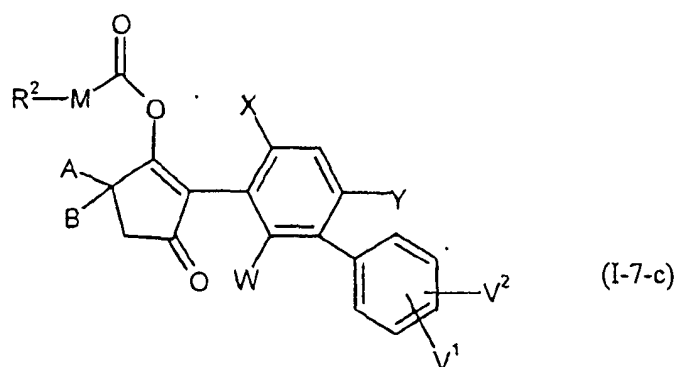
实施例 I-7-c-1



通过实施例 (I-2-c-1) 的方法, 通过使实施例 (I-7-a-3) 化合物与氯甲酸乙酯反应而制备。产量 1.3g。蜡。

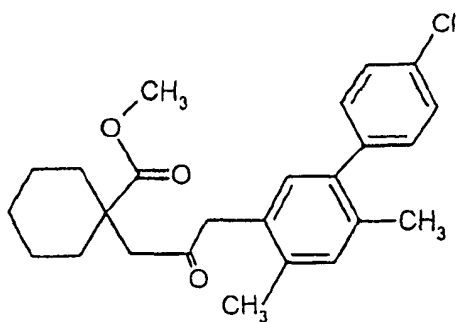
^1H NMR (400 MHz, d_6 -DMSO): 1.2 (t, 3H, CH_2CH_3); 1.3-1.8 (m, 10H, 环己基); 1.65, 1.9, 2.05 (s, 3 x 3H, Ar- CH_3); 3.05 (bs, 2H, 环戊基 CH_2); 4.2 (q, 2H, OCH_2); 7.0 - 7.5 (m, 5H, Ar-H).

通过实施例 (I-7-c-1) 和/或根据制备式 (I-7-c) 的一般程序, 获得下列化合物



实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	M	R ²	m.p. (°C)
I-7-c-2	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	oil

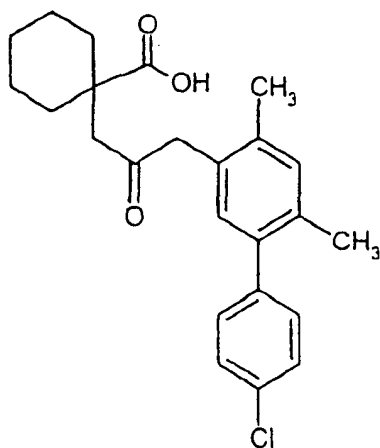
实施例 X-1



将 24g 实施例 (XXXVIII-1) 化合物的粗制产物在回流下在 140ml 丙酮中与 8.2g 碳酸钾和 25.4g 甲基碘一起加热 16 小时。将混合物过滤, 并浓缩, 残余物经硅胶纯化: 移动相为二氯甲烷/石油醚 2/1, 最终纯的二氯甲烷。产量 5.6g.

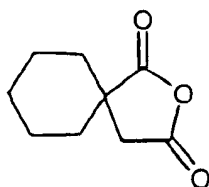
^1H NMR (400 MHz, d_6 -DMSO): $\delta=1.2-1.8$ (m, 10H, 环己基 H); 2.1, 2.2 (s, 6H, 2xAr-CH₃); 2.9, 3.8 (s, 4H, 2xCOCH₂); 3.5 (s, 3H, OCH₃); 6.95-7.5 (s, 6H, Ar-H) ppm.

实施例 XXXVIII-1

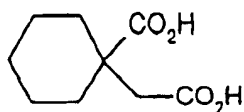


在 -15°C 下, 将 17.9g 实施例 XXXII-1 化合物的溶液滴加入 30ml LDA 溶液 (2M, 1.1eq) 在 60ml THF 中的溶液中, 将混合物在 0°C 下搅拌 1 小时。在 -15°C 下, 滴加入 6.1g 实施例 XLI-1 化合物在 10ml THF 中的溶液。混合物在室温下搅拌 2 小时, 加入 100ml 水和 24g 氯化铵, 并将混合物用浓盐酸酸化。中间体用醚萃取。将萃取液浓缩, 残余物与 60g KOH 在 220ml 水中加热 2 天。冷却后, 将混合物用浓盐酸酸化, 并用醚萃取。粗产物作进一步的反应, 无需纯化。产量 24g。

实施例 XLI-1

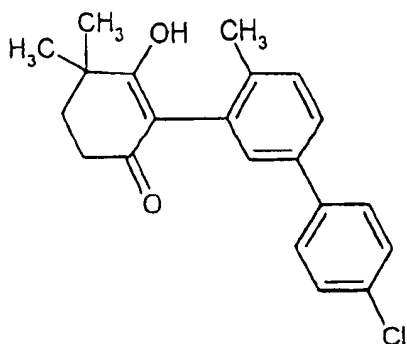


将在 500ml 乙酸酐中的 100g 化合物



回流加热。将混合物浓缩，残余物溶解于少量二氯甲烷中，并与正己烷混合。混合物留在冷却装置中过夜，抽吸滤出并干燥。产量 74.8g.

实施例 I-8-a-1

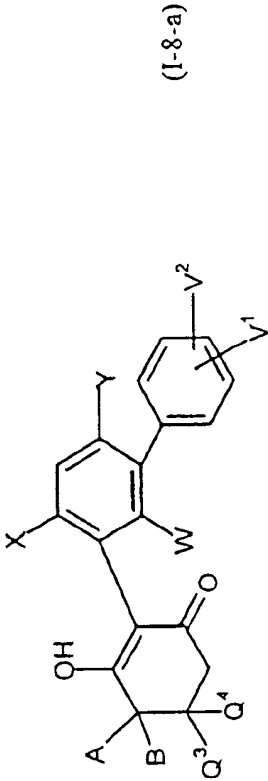


将 0.95g 叔丁醇钾加入到在 10ml DMF 中的 2.1g 实施例 (XI-1) 化合物中，并将此混合物在 80℃ 下加热 2 小时。用冰冷却，将混合物缓慢加入到大约 1 升 1N HCl 中，并抽吸滤出沉淀物。

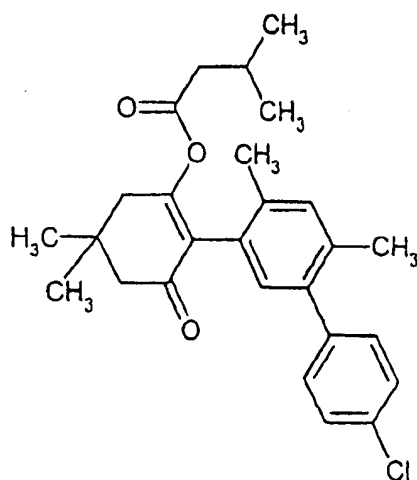
产量 0.2g

^1H NMR, (400 MHz, d_6 -DMSO): δ =1.1 (s, 6H, C-CH₃); 1.85 (m, 2H, COCH₂CH₂); 2.0 (s, 3H, ArCH₃); 2.65 (m, 2H, COCH₂CH₂); 7.1-7.6 (m, 7H, Ar-H) ppm.

通过实施例 (I-8-a-1) 的方法，和/或根据制备式 (I-8-a) 化合物的一般程序，获得下列化合物

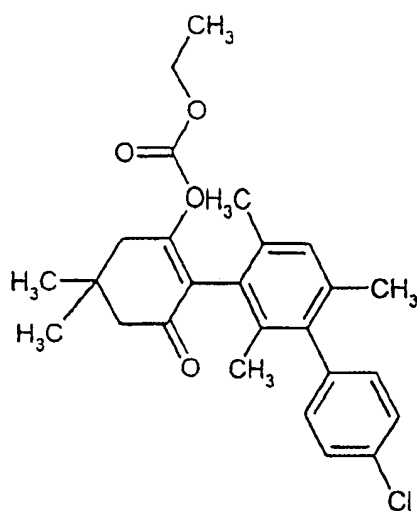


实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	Q ³	Q ⁴	m.p. (°C)
I-8-a-2	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	H	CH ₃	CH ₃	223-225
I-8-a-3	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	CH ₃	CH ₃	H	H	树脂
I-8-a-4	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	H	CH ₃	CH ₃	树脂
I-8-a-5	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	H	CH ₃	CH ₃	>250

实施例 I-8-b-1

通过实施例 (I-2-b-1) 的方法, 通过使实施例 (I-8-a-2) 化合物与异戊酰氯反应而制备。油。

^1H NMR (400 MHz, d_6 -DMSO): 1.1 (δ , 6H, 2xCHCH₃); 1.1 (s, 6H, 2xCCH₃); 1.65 (m, 1H, CHCH₃); 2.0, 2.2 (s, 6H, ArCH₃); 6.7-7.5 (m, 6H, Ar-H) ppm.

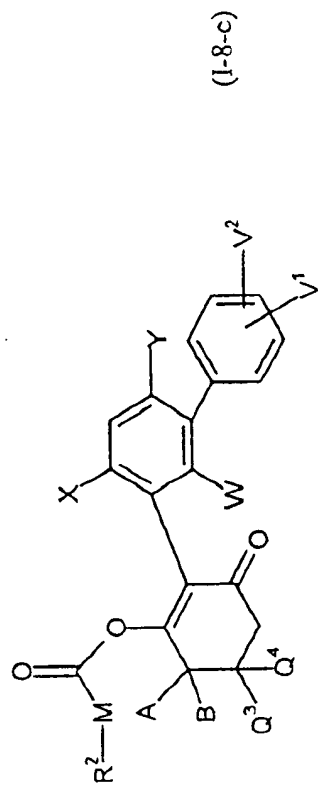
实施例 I-8-c-1

通过实施例 (I-2-c-1) 的方法, 通过使实施例 (I-8-a-5) 化合物与

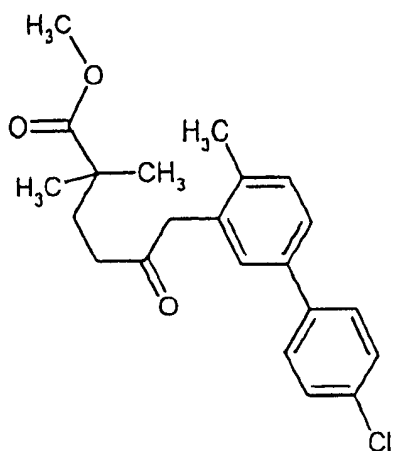
氯甲酸乙酯反应而制备。

^1H NMR (400 MHz, d_6 -DMSO): δ =1.1 (t, 3H, CH_2CH_3); 1.14 1.18 (s, 2x3H, C- CH_3);
1.9 2.0 2.1 (s, 3x3H, Ar CH_3); 2.45 2.7 (d, 2x2H, 环己基 - CH_2); 4.1 (q, 2H, OCH $_2$);
7.0 - 7.5 (m, 5H, Ar-H) ppm.

通过实施例 (I-8-c-1) 的方法, 和/或根据制备式 (I-8-c) 化合物的一般程序, 获得下列化合物

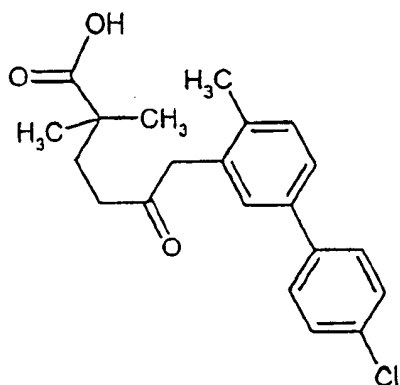


实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	Q ³	Q ⁴	M	R ²	m.p. (°C)
I-8-c-2	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	H	CH ₃	CH ₃	O	C ₂ H ₅	油状物

实施例 XI-1

将 38.2g 实施例 XLII-1 化合物、14.6g 碳酸钾和 45.25g 甲基碘在 250ml 丙酮中加热回流 16 小时。将混合物过滤，并浓缩，残余物经硅胶纯化：移动相，二氯甲烷/石油醚 2/1，最终纯的二氯甲烷。产量 2.1g 油。

^1H NMR (400 MHz, d_6 -DMSO): 1.1 (s, 6H, $2\times\text{CCH}_3$); 1.7 (m, 2H, COCH_2CH_2); 2.15 (s, 3H, ArCH_3); 2.55 (m, 2H, COCH_2CH_2); 3.55 (s, 3H, OCH_3); 7.2-7.7 (m, 7H, Ar-H) ppm.

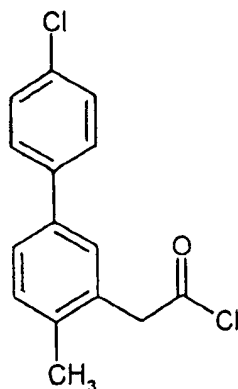
实施例 XLII-1

在 -15°C 下，将 34g 实施例 XXXII-2 化合物在 30ml THF 中的溶液

滴加入 60ml LDA 溶液 (2 摩尔, 1.1eq) 在 120ml THF 中的溶液中, 将混合物在 0℃ 下搅拌 1 小时. 在 -15℃ 下, 滴加入 10.3g 2,2-二甲基戊二酸酐在 20ml THF 中的溶液. 混合物在室温下搅拌 2 小时, 加入 180ml 水和 48g 氯化铵, 并将混合物用浓盐酸酸化. 中间体用醚萃取. 将萃取液浓缩, 残余物与 120g KOH 在 400ml 水中加热回流 2 天.

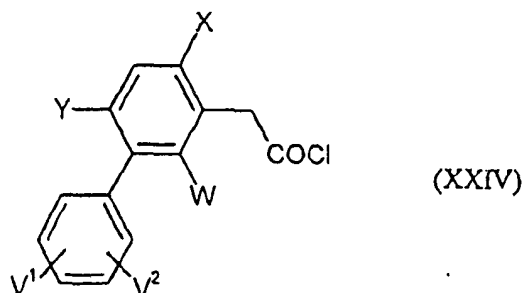
冷却后, 将混合物用浓盐酸酸化, 并用醚萃取. 余下的粗制产物在去除醚之后, 作进一步反应, 无需纯化. 产量 38.4g 油.

实施例 XXIV-1



将在 55ml 亚硫酸氯中的 65.2g 实施例 XXVII-2 化合物在 70℃ 下加热, 直到不再产生气体. 去除过量的亚硫酸氯, 残余物在高真空下蒸馏. 产量: 32g, m. p. 46℃.

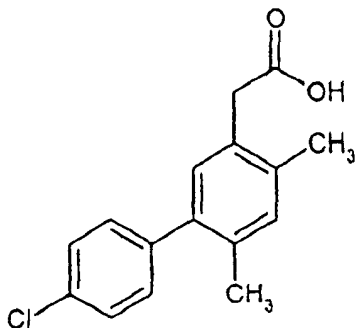
通过实施例 (XXIV-1) 的方法和/或根据制备实施例 (XXIV) 化合物的一般程序, 获得下列式 (XXIV) 化合物



实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	m.p. (°C)
XXIV-2	H	CH ₃	H	4-Cl	H	*
XXIV-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	*
XXIV-4	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	*

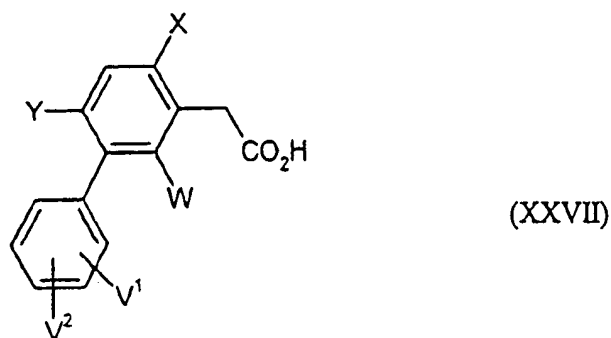
*采用这些化合物无需进一步纯化就可用于制备式 (II) 或 (III) 化合物。

实施例 XXVII-1



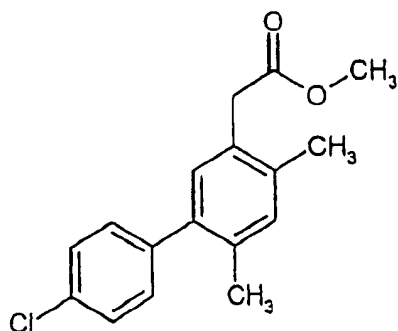
将在 280ml 水中的 3.04g LiOH 滴加入在 280ml THF 中的 35g 实施例 XXXII-1 化合物中，加入 10ml 乙醇，并将混合物在室温下搅拌过夜。之后将混合物浓缩，残余物与水混合，用 MTBE 萃取。水相用浓盐酸酸化，将混合物抽吸滤出，过滤残余物用己烷洗涤。产量 21g，m. p. 133°C。

通过实施例 (XXVII-1) 的方法，和/或根据制备式 (XXVII) 化合物的一般程序，获得下列化合物。



实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	m.p. °C
XXVII-2	H	CH ₃	H	4-Cl	H	137
XXVII-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	138
XXVII-4	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	134
XXVII-5	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	153

实施例 XXXII - 1



方案 A

将 54g 实施例 XLV-1 化合物加入在 1 升甲醇中的 31g KOH 中，将混合物在室温下过夜。将混合物抽吸滤出，过滤残余物用甲醇洗涤。将滤液浓缩，将残余物与水混合，用二氯甲烷萃取。将有机相浓缩。产量 10g。

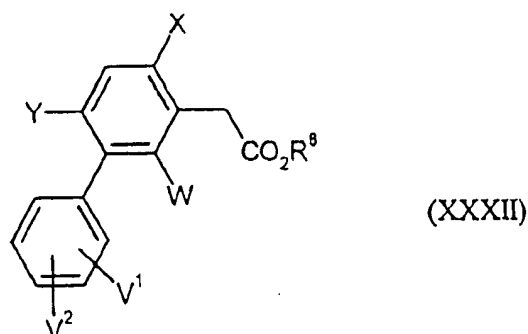
方案 B

将 96g 3-溴-4,6-二甲基苯基乙酸甲酯、65g 4-氯苯基硼酸和

1.5g 双(三苯基膦)钼(II)氯化物在 1 升二甲氧基乙烷和 700ml 1M Na_2CO_3 溶液在回流下加热过夜。将混合物在水和 EA 中分配,有机相用饱和氯化铵溶液、水和饱和氯化钠溶液洗涤并浓缩。产量 61g。

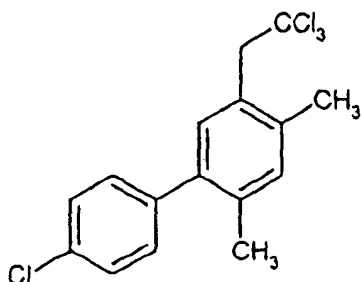
^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ = 2.21, 2.31 (2s, 6H, Ar- CH_3); 3.63 (s, 2H, CH_2); 3.69 (s, 3H, OCH_3); 7.03-7.1 (2s, 2H, Ar-H); 7.25, 7.38 (AA', BB', 4H, Ar-H) ppm.

通过实施例 (XXXII-1), 方案 B, 和/或根据制备式 (XXXII) 化合物的一般程序, 获得下列式 (XXXII) 化合物



实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	R ⁸	m.p. °C
XXXII-2	H	CH ₃	H	4-Cl	H	CH ₃	油
XXXII-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	CH ₃	68
XXXII-4	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	CH ₃	油
XXXII-5	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	CH ₃	油

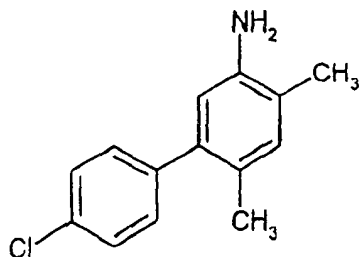
实施例 XLV-1



将 29.5g 无水氯化铜(II)导入 33g 异戊腈的 120ml 乙腈溶液中。混合物与 271g 二氯乙烯($\text{CH}_2 = \text{CCl}_2$)混合,随后与溶解于乙腈中的 43g 实施例 XLVI-1 化合物混合,混合物在室温下搅拌,直到不再产生气体。之后将混合物倒入 800ml 冰-冷却的浓度为 20% 的盐酸中,并用 MTBE 反复萃取。有机相用浓度为 20% 的盐酸洗涤,并浓缩。

产量 19g。产物直接进一步反应,无需任何纯化。

实施例 XLVI-1

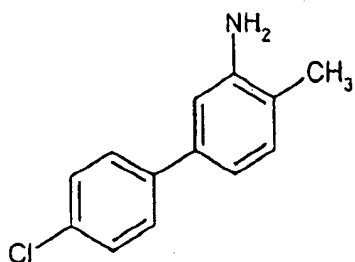


由 3-溴-4,6-二甲基苯胺和 4-氯苯基硼酸为原料,通过 Suzuki 偶联获得,反应按照实施例 XXXII-1 方案 B 那样进行。

产量 12g。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ = 2.12 (s, 3H, Ar- CH_3), 2.18 (s, 3H, Ar- CH_3), 3.35 (brd, 2H, NH_2), 6.53 (s, 1H, Ar-H), 6.94 (s, 1H, Ar-H), 7.23 (AA',BB', 2H, Ar-H), 7.35 (AA',BB', 2H, Ar-H).

实施例 XLVI-2



由 3-溴-6-甲基苯胺为原料，通过相同的方法获得。M. p. 184℃.

实施例

桃蚜试验

溶剂：1 份重量的二甲基甲酰胺

乳化剂：1 份重量的烷基芳基聚乙二醇醚

为制备活性化合物的适合制剂，将 1 份重量的活性化合物与所述的溶剂和乳化剂混合，并将此乳油用水稀释至所需的浓缩。

将长有大量桃蚜 (*Myzus persicae*) 的甘蓝 (*Brassica oleracea*) 叶通过浸入所需浓缩的活性化合物制剂中进行处理。

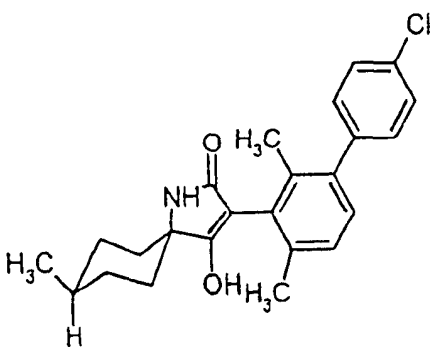
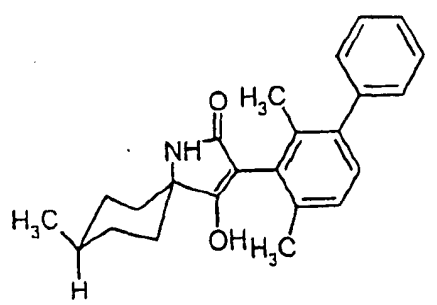
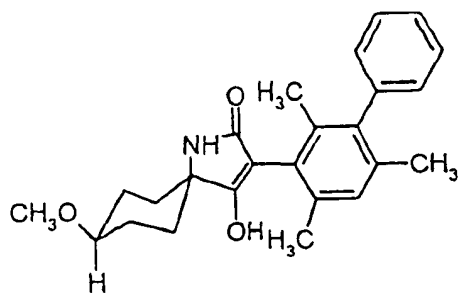
在所需的时间之后，测定杀死 %。100% 指所有的蚜虫均被杀死；0% 指没有蚜虫被杀死。

在此试验中，例如下列制备实施例化合物显示出良好的效力：

表格

植食性昆虫

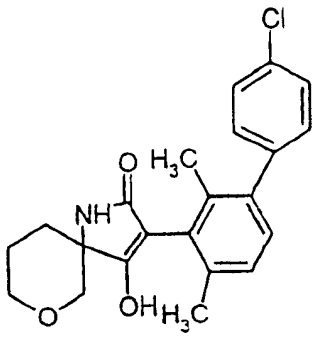
桃蚜试验

活性化合物	活性化合物浓度 (%)	6天后的杀死率 (%)
Ex. I-1-a-3 	0.1	98
Ex. I-1-a-2 	0.1	95
Ex. I-1-a-6 	0.1	100

表格 - 续

植食性昆虫

桃蚜试验

活性化合物	活性化合物浓度 (%)	6天后的杀死率 (%)
Ex. I-1-a-7 	0.1	98

实施例

辣根猿叶甲试验

溶剂：7份重量的二甲基甲酰胺

乳化剂：1份重量的烷基芳基聚乙二醇醚

为制备活性化合物的适合制剂，将1份重量的活性化合物与所述的溶剂和乳化剂混合，并将此乳油用水稀释至所需的浓缩。

将甘蓝(*Brassica oleracea*)叶通过浸入所需浓缩的活性化合物制剂中，当叶片仍就湿润时，移入辣根猿叶甲(*Phaedon cochleariae*)幼虫。

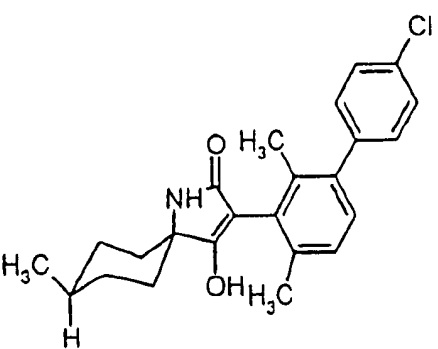
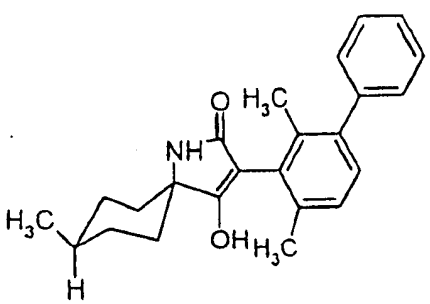
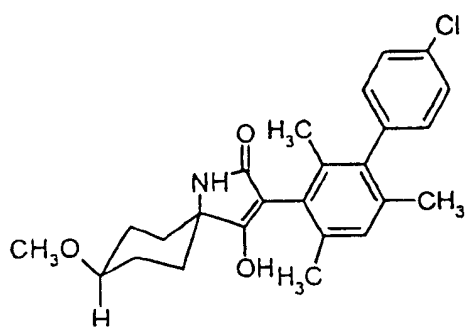
在所需的时间之后，测定杀死%。100%指所有的幼虫均被杀死；0%指没有幼虫被杀死。

在此试验中，例如下列制备实施例化合物显示出良好的效力：

表格

植食性昆虫

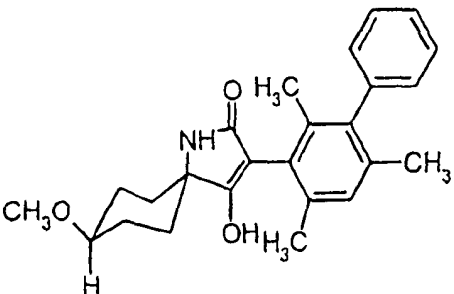
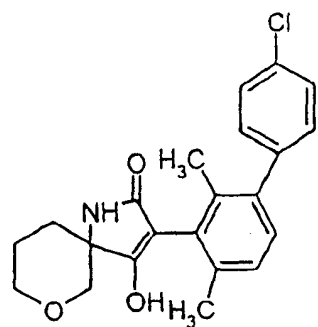
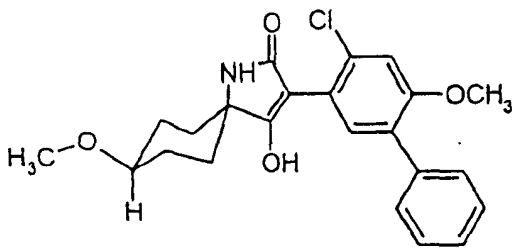
辣根猿叶甲幼虫试验

活性化合物	活性化合物浓度 (%)	7天后的杀死率 (%)
Ex. I-1-a-3 	0.1	100
Ex. I-1-a-2 	0.1	100
Ex. I-1-a-5 	0.1	100

表格-续

植食性昆虫

辣根猿叶甲幼虫试验

活性化合物	活性化合物浓度 (%)	7天后的杀死率 (%)
Ex. I-1-a-6 	0.1	100
Ex. I-1-a-7 	0.1	100
Ex. I-1-a-13 	0.1	100

实施例

斜纹叶蛾试验

溶剂：7份重量的二甲基甲酰胺

乳化剂：1份重量的烷基芳基聚乙二醇醚

为制备活性化合物的适合制剂，将1份重量的活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合，并将此乳油用水稀释至所需的浓缩。

将甘蓝(*Brassica oleracea*)叶通过浸入所需浓缩的活性化合物制剂中，当叶片仍就湿润时，移入斜纹叶蛾 (*Spodoptera frugiperda*) 幼虫。

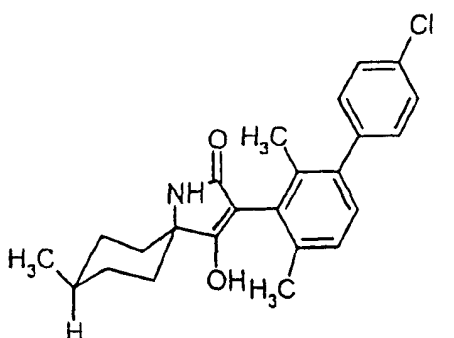
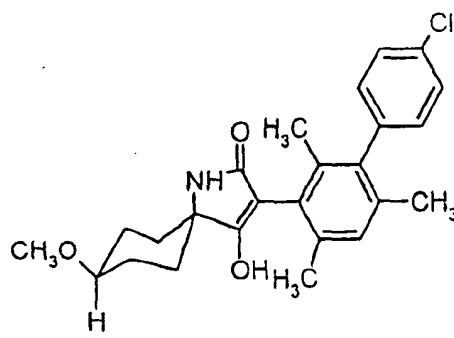
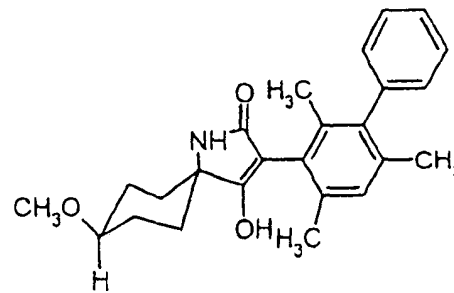
在所需的时间之后，测定杀死%。100%指所有的幼虫均被杀死；0%指没有幼虫被杀死。

在此试验中，例如下列制备实施例化合物显示出良好的效力：

表格

植食性昆虫

斜纹叶蛾幼虫试验

活性化合物	活性化合物浓度 (%)	7天后的杀死率 (%)
Ex. I-1-a-3 	0.1	100
Ex. I-1-a-5 	0.1	100
Ex. I-1-a-6 	0.1	100

实施例

叶螨试验(OP-抗性/浸醮处理)

溶剂: 7份重量的二甲基甲酰胺

乳化剂: 1份重量的烷基芳基聚乙二醇醚

为制备活性化合物的适合制剂, 将1份重量的活性化合物与所述的溶剂和乳化剂混合, 并将此乳油用水稀释至所需的浓缩。

将长有大量所有生长期的二点叶螨(*Tetranychus urticae*)的菜豆(*Phaseolus vulgaris*)叶浸入所需浓缩的活性化合物制剂中。

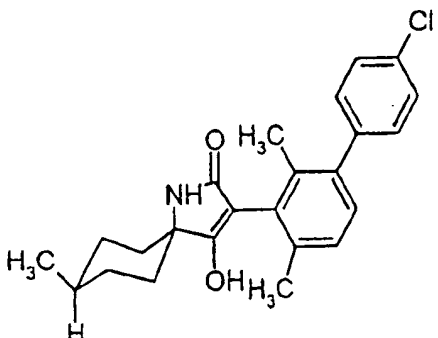
在所需的时间之后, 测定杀死%。100%指所有的叶螨均被杀死; 0%指没有叶螨被杀死。

在此试验中, 例如下列制备实施例化合物显示出良好的效力:

表格-续

植食性昆虫

叶螨试验(OP-抗性/浸蘸处理)

活性化合物	活性化合物浓度 (%)	7天后的杀死率 (%)
Ex. I-1-a-3 	0.1	100