



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 101772503 B

(45) 授权公告日 2013. 07. 03

(21) 申请号 200880101454. 0

代理人 吴晓萍 钟守期

(22) 申请日 2008. 07. 22

(51) Int. Cl.

(30) 优先权数据

07113674. 1 2007. 08. 02 EP

C07D 491/10 (2006. 01)

C07D 493/10 (2006. 01)

A01N 43/12 (2006. 01)

A01N 43/16 (2006. 01)

A01N 43/38 (2006. 01)

C07D 307/94 (2006. 01)

(85) PCT申请进入国家阶段日

2010. 02. 01

(86) PCT申请的申请数据

PCT/EP2008/005973 2008. 07. 22

(87) PCT申请的公布数据

W02009/015801 DE 2009. 02. 05

(73) 专利权人 拜耳农作物科学股份公司

地址 德国蒙海姆

(72) 发明人 T·布雷特施奈德 R·菲舍尔

G·朗格 S·莱尔 C·阿诺德

D·福伊希特 E-M·弗兰肯

M·J·希尔斯 H·科恩 O·马萨姆

C·H·罗辛格 J·迪特根

U·葛约根斯 I·怀瑟-哈恩

(56) 对比文件

CN 1721417 A, 2006. 01. 18, 说明书第 6 页第 15-16 行到第 7 页第 1-3 行和权利要求 1, 说明书第 11 页步骤 E, 说明书第 11 页步骤 D, 说明书第 6 页第 11-14 行, 说明书第 6 页第 7-10 行, 说明书第 11 页步骤 C.

CN 1086213 A, 1994. 05. 04, 说明书第 87 页表 4, 权利要求 4.

WO 2006089633 A2, 2006. 08. 31, 权利要求 1-7、10-15.

CN 1086213 A, 1994. 05. 04, 说明书第 87 页表 4, 权利要求 4.

(74) 专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司 11285

审查员 秦雪

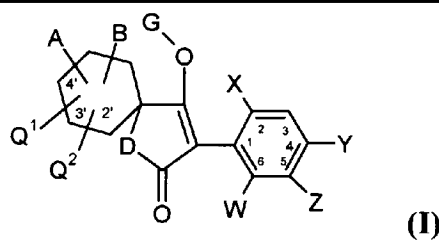
权利要求书10页 说明书110页

(54) 发明名称

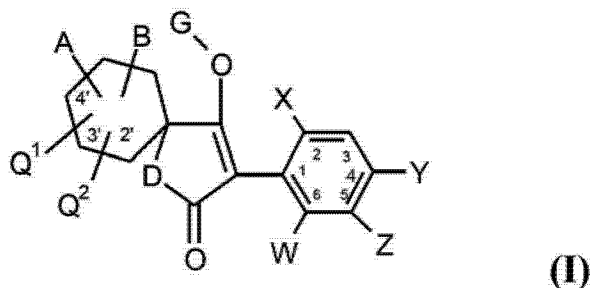
氧杂螺环型螺取代的特特拉姆酸及特窗酸衍生物

(57) 摘要

本发明涉及新的式 (I) 氧杂螺环型螺苯基取代的特特拉姆酸和特窗酸衍生物, 其中 W、X、Y、Z、A、B、D、Q¹、Q²和 G 具有说明书给出的含义, 涉及其多种制备方法并涉及其用作害虫防治剂和 / 或除草剂的用途。本发明还涉及这样的选择性除草组合物, 其一方面含有氧杂螺环型螺苯基取代的特特拉姆酸和特窗酸衍生物, 并且另一方面含有一种改进栽培植物相容性的化合物。本发明还涉及通过添加铵盐或磷盐及任选的促渗剂来提高含式 (I) 化合物的作物保护组合物的效果。



1. 式 (I) 的化合物

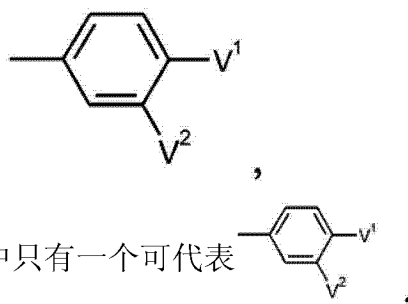


其中

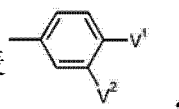
W 代表氢、氯、溴、甲基、乙基或甲氧基，

X 代表氯、溴、甲基、乙基或甲氧基，

Y 和 Z 相互独立地代表氢、氯、溴、甲基，或代表基团



其中在此情况下，基团 Y 或 Z 中只有一个可代表



V¹ 代表氟或氯，

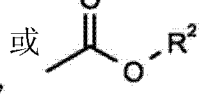
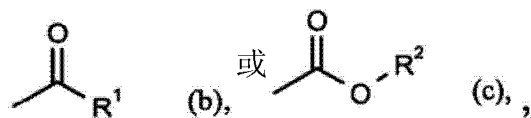
V² 代表氢、氟或氯，

A 和 B 与它们所连接的 4' 位碳原子代表一个四氢呋喃环，

D 代表 NH 或氧，

Q¹ 和 Q² 代表氢，

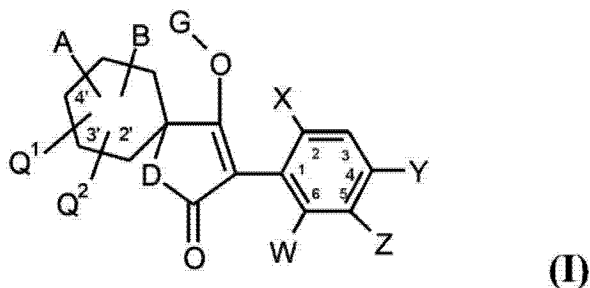
G 代表氢 (a) 或代表以下基团之一



R¹ 代表 C₁-C₁₀ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₂ 烷基、或 C₃-C₆ 环烷基，

R² 代表 C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 烯基，或代表苄基。

2. 式 (I) 化合物，



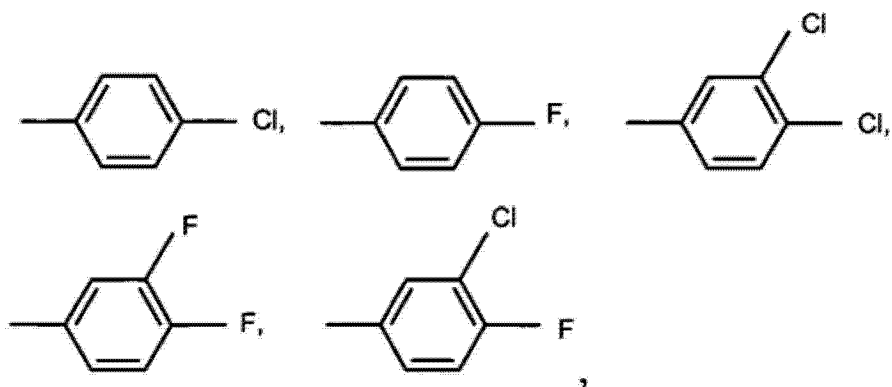
其中

W 代表氢、氯、溴、甲基或乙基，

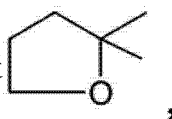
X 代表氯、溴、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基或环丙基，

Y 代表氢、甲基、乙基、氯、溴、碘、氟、三氟甲氧基或环丙基，

Z 代表氢、溴、甲基或基团



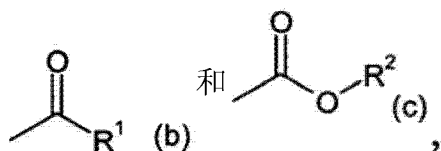
A 和 B 与它们所连接的 4' 位碳原子代表



D 代表 NH 或氧，

Q¹ 和 Q² 代表氢，

G 代表氢 (a) 或以下基团之一

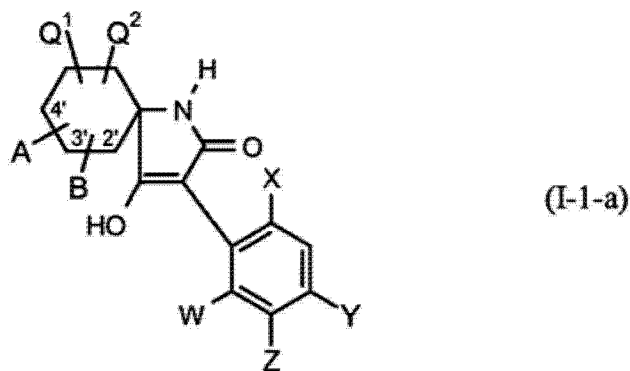


R¹ 代表 C₁-C₆ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₂ 烷基或环丙基，

R² 代表 C₁-C₆ 烷基或苄基。

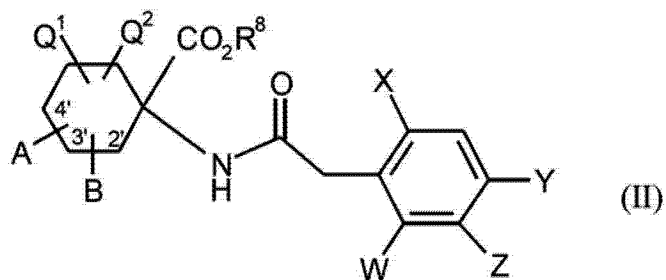
3. 制备权利要求 1 或 2 的式 (I) 化合物的方法，其特征在于，

(A) 为获得式 (I-1-a) 化合物，使式 (II) 化合物在一种稀释剂的存在下并且在一种碱的存在下进行分子内缩合



其中

A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有权利要求 1 或 2 给出的含义，



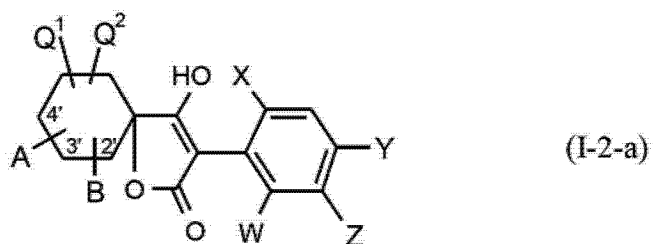
其中

A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义，

并且

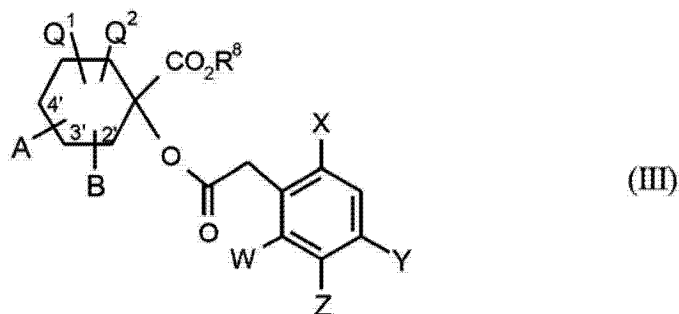
R⁸ 代表烷基，

(B) 为获得式 (I-2-a) 化合物，使式 (III) 化合物在一种稀释剂的存在下并且在一种碱的存在下进行分子内缩合



其中

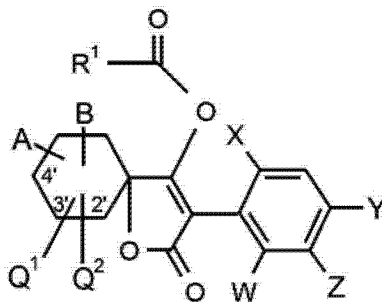
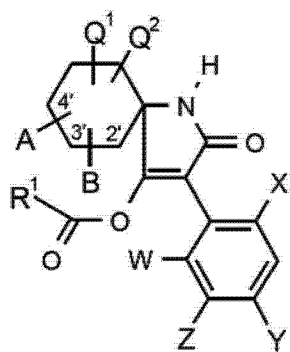
A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有权利要求 1 或 2 给出的含义，



其中

A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z 和 R⁸ 具有上文给出的含义，

(C) 为获得上文所示式 (I-1-b) 至 (I-2-b) 化合物，



其中 R¹、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有权利要求 1 或 2 给出的含义，

使上文所示式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物——其中 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义——各自与下列化合物反应, 反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行,

α) 与式 (IV) 化合物反应



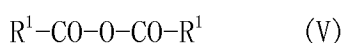
其中

R¹ 具有上文给出的含义, 并且

Hal 代表卤素

或

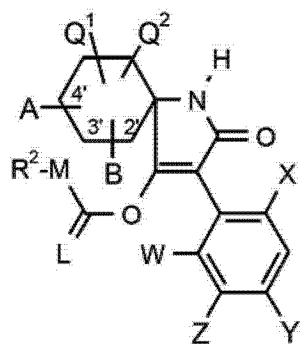
β) 与式 (V) 的羧酸酐反应



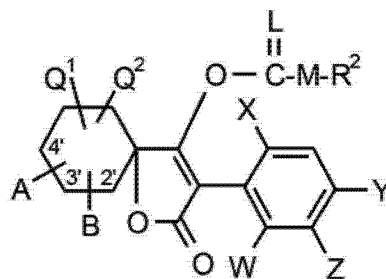
其中

R¹ 具有上文给出的含义,

(D) 为获得上文所示式 (I-1-c) 至 (I-2-c) 化合物,



(I-1-c)



(I-2-c)

其中 R²、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有权利要求 1 或 2 给出的含义并且 L 和 M 代表氧,

使上文所示式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物——其中 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义——各自与式 (VI) 的氯甲酸酯反应, 反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行,

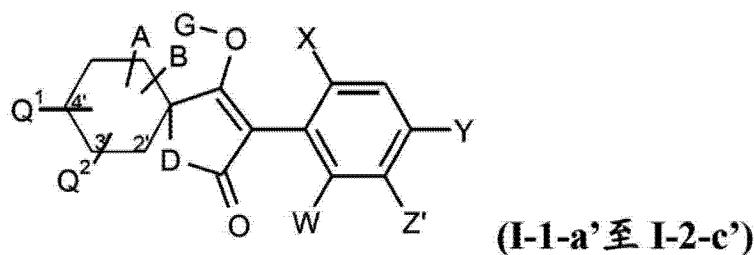


其中

R² 和 M 具有上文给出的含义,

(J α) 为获得上文所示式 (I-1-a) 至 (I-2-c) 的化合物, 其中 A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有权利要求 1 或 2 给出的含义,

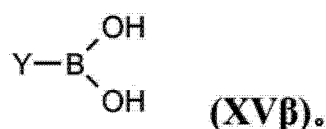
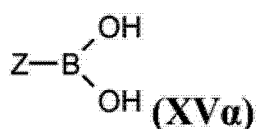
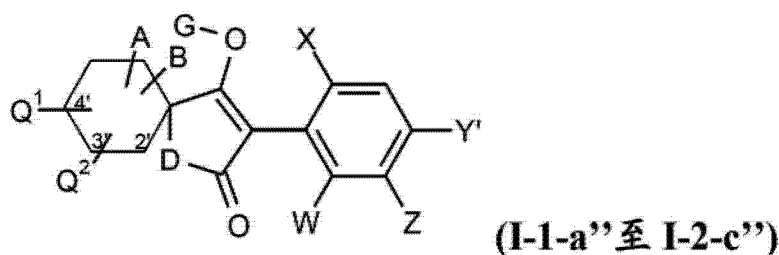
使式 (I-1-a') 至 (I-2-c') 的化合物, 其中 A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X 和 Y 具有上文给出的含义并且 Z' 代表溴或碘, 与式 (XV α) 的能够偶合的芳基衍生物或其酯在一种溶剂的存在下、在一种催化剂的存在下和在一种碱的存在下进行偶合,



以及

(J β) 为获得上文所示式 (I-1-a) 至 (I-2-c) 的化合物, 其中 A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有权利要求 1 或 2 给出的含义,

使式 (I-1-a'') 至 (I-2-c'') 的化合物, 其中 A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X 和 Z 具有上文给出的含义并且 Y' 代表溴或碘, 与式 (XV β) 的能够偶合的芳基衍生物或其酯在一种溶剂的存在下、在一种催化剂的存在下和在一种碱的存在下进行偶合,



4. 用于防治害虫和 / 或不想要的植物的组合物, 其特征在于它们含有至少一种权利要求 1 或 2 的式 (I) 化合物。

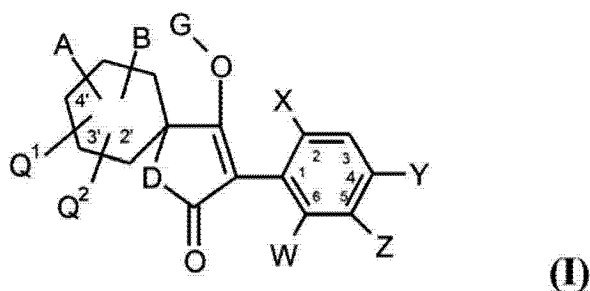
5. 非治疗目的的用于防治动物有害物和 / 或不想要的植物的方法, 其特征在于使权利要求 1 或 2 的式 (I) 化合物作用于害虫、不想要的植物和 / 或它们的生境。

6. 权利要求 1 或 2 的式 (I) 化合物用于防治动物有害物和 / 或不想要的植物的非治疗目的的用途。

7. 用于制备防治害虫和 / 或不想要的植物的组合物的方法, 其特征在于将权利要求 1 或 2 的式 (I) 化合物与填充剂和 / 或表面活性剂混合。

8. 权利要求 1 或 2 的式 (I) 化合物用于制备防治害虫和 / 或不想要的植物的组合物的用途。

9. 包含有效量的活性化合物结合物的组合物, 所述活性化合物结合物含有组分 (a') 至少一种式 (I) 化合物,



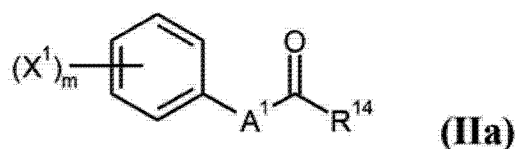
其中 A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有权利要求 1 或 2 给出的含义和

(b') 至少一种选自以下化合物的改进作物植物相容性的化合物：

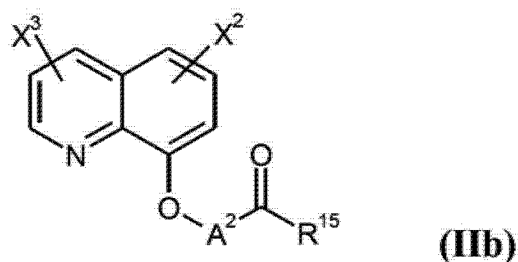
4-二氯乙酰基-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷、1-二氯乙酰基六氢-3,3,8a-三甲基吡咯并[1,2-a]嘧啶-6(2H)-酮、4-二氯乙酰基-3,4-二氢-3-甲基-2H-1,4-苯并噁嗪、5-氯喹啉-8-氧基乙酸 1-甲基己基酯、3-(2-氯苄基)-1-(1-甲基-1-苯基乙基)脲、 α -(氰基甲氧亚氨基)-苯基乙腈、2,4-二氯苯氧基乙酸(2,4-D)、4-(2,4-二氯苯氧基)丁酸、1-(1-甲基-1-苯基乙基)-3-(4-甲基苯基)脲、3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸、S-1-甲基-1-苯基乙基哌啶-1-硫代羧酸酯、2,2-二氯-N-(2-氧代-2-(2-丙烯基氨基)乙基)-N-(2-丙烯基)乙酰胺、2,2-二氯-N,N-二-2-丙烯基乙酰胺、4,6-二氯-2-苯基嘧啶、1-(2,4-二氯苯基)-5-三氯甲基-1H-1,2,4-三唑-3-羧酸乙酯、2-氯-4-三氟甲基噻唑-5-羧酸苯基甲基酯、4-氯-N-(1,3-二氧戊环-2-基甲氧基)- α -三氟苯乙酮肟、3-二氯乙酰基-5-(2-呋喃基)-2,2-二甲基噁唑烷、4,5-二氢-5,5-二苯基-3-异噁唑羧酸乙酯、3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸 1-(乙氧基羰基)乙酯、(4-氯-o-甲苯氧基)乙酸、2-(4-氯-o-甲苯氧基)丙酸、1-(2,4-二氯苯基)-4,5-二氢-5-甲基-1H-吡唑-3,5-二羧酸二乙酯、2-二氯甲基-2-甲基-1,3-二氧戊环、2-丙烯基-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷-4-二硫代羧酸酯、1,8-萘二甲酸酐、 α -(1,3-二氧戊环-2-基甲氧亚氨基)苯基乙腈、2,2-二氯-N-(1,3-二氧戊环-2-基甲基)-N-(2-丙烯基)乙酰胺、3-二氯乙酰基-2,2-二甲基噁唑烷、3-二氯乙酰基-2,2,5-三甲基噁唑烷、4-(4-氯-o-甲苯基)丁酸、4-(4-氯苯氧基)丁酸、二苯基甲氧基乙酸、二苯基甲氧基乙酸甲酯、二苯基甲氧基乙酸乙酯、1-(2-氯苯基)-5-苯基-1H-吡唑-3-羧酸甲酯、1-(2,4-二氯苯基)-5-甲基-1H-吡唑-3-羧酸乙酯、1-(2,4-二氯苯基)-5-异丙基-1H-吡唑-3-羧酸乙酯、1-(2,4-二氯苯基)-5-(1,1-二甲基乙基)-1H-吡唑-3-羧酸乙酯、1-(2,4-二氯苯基)-5-苯基-1H-吡唑-3-羧酸乙酯、5-(2,4-二氯苄基)-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯、5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯、5-(4-氟苯基)-5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸 1,3-二甲基丁-1-基酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸 4-烯丙氧基丁基酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸 1-烯丙氧基丙-2-基酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸甲酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸乙酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸烯丙酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸 2-氧代丙-1-基酯、5-氯喹啉-8-氧基丙二酸二乙酯、5-氯喹啉-8-氧基丙二酸二烯丙酯、5-氯喹啉-8-氧基丙二酸二乙酯、4-羧基苯并二氢吡喃-4-基乙酸、4-氯苯氧基乙酸、3,3'-二甲基-4-甲氧基二苯甲酮、1-溴-4-氯甲基磺酰基苯、1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨磺酰基)苯基]-3-甲基脲、1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨磺酰基)苯基]-3,3-二甲基脲、1-[4-(N-4,5-二甲基苯甲酰基氨磺酰基)苯基]-3-甲基脲、1-[4-(N-萘基氨磺酰基)苯基]-3,3-二甲基脲、N-(2-甲氧基-5-甲基苯甲酰基)-4-(环丙基氨基羰基)苯磺酰胺，

和 / 或由以下通式定义的化合物之一：

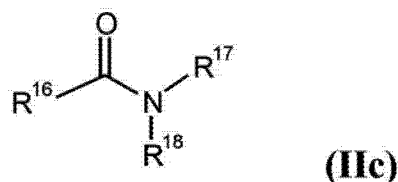
通式 (IIa)



或通式 (IIb)



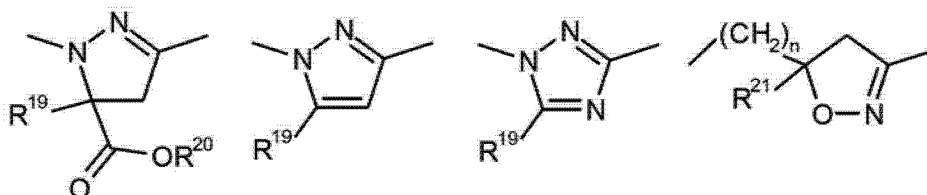
或式 (IIc)



其中

m 代表数值 0、1、2、3、4 或 5，

A¹ 代表以下所示二价杂环基之一，



n 代表数值 0、1、2、3、4 或 5，

A² 代表任选被 C₁-C₄ 烷基和 / 或 C₁-C₄ 烷氧基 - 羰基和 / 或 C₁-C₄ 烯氧基 - 羰基取代的具有 1 或 2 个碳原子的烷二基，

R¹⁴ 代表羟基、巯基、氨基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 烷基氨基或二 (C₁-C₄ 烷基) 氨基，

R¹⁵ 代表羟基、巯基、氨基、C₁-C₇ 烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 烯氧基、C₁-C₆ 烯氧基 - C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 烷基氨基或二 (C₁-C₄ 烷基) 氨基，

R¹⁶ 代表任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C₁-C₄ 烷基，

R¹⁷ 代表氢，各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烯基或 C₂-C₆ 炔基，C₁-C₄ 烷氧基 - C₁-C₄ 烷基、二氧戊环基 - C₁-C₄ 烷基、呋喃基、呋喃基 - C₁-C₄ 烷基、噻吩基、噻唑基、嘧啶基，或任选被氟、氯和 / 或溴或者 C₁-C₄ 烷基取代的苯基，

R¹⁸ 代表氢，各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烯基或 C₂-C₆ 炔基，C₁-C₄ 烷氧基 - C₁-C₄ 烷基、二氧戊环基 - C₁-C₄ 烷基、呋喃基、呋喃基 - C₁-C₄ 烷基、噻吩基、噻唑基、嘧啶基，或任选被氟、氯和 / 或溴或者 C₁-C₄ 烷基取代的苯基，

R¹⁷ 和 R¹⁸ 还一起代表各自任选被 C₁-C₄ 烷基、苯基、呋喃基、稠合苯环或者被两个与它所连接的 C 原子一起形成一个 5 元或 6 元碳环的取代基取代的 C₃-C₆ 烷二基或 C₂-C₅ 氧杂烷二基，

R¹⁹ 代表氢、氰基、卤素，或者代表各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C₁-C₄ 烷基、C₃-C₆ 环烷基或苯基，

R²⁰ 代表氢，各自任选被羟基、氰基、卤素或 C₁-C₄ 烷氧基取代的 C₁-C₆ 烷基、C₃-C₆ 环烷基

或三 (C₁-C₄ 烷基) 甲硅烷基,

R²¹ 代表氢、氰基、卤素, 或者代表各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C₁-C₄ 烷基、C₃-C₆ 环烷基或苯基,

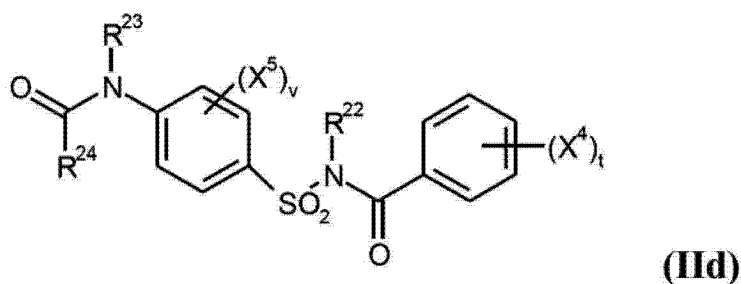
X¹ 代表硝基、氰基、卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基或 C₁-C₄ 卤代烷氧基,

X² 代表氢、氰基、硝基、卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基或 C₁-C₄ 卤代烷氧基,

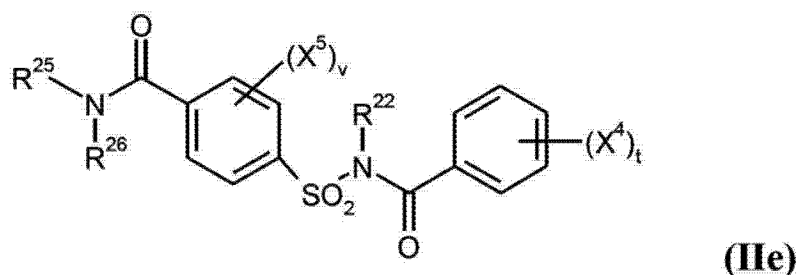
X³ 代表氢、氰基、硝基、卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基或 C₁-C₄ 卤代烷氧基,

和 / 或由下列通式定义的化合物:

通式 (IIId)



或通式 (IIe)



其中

t 代表数值 0、1、2、3、4 或 5,

v 代表数值 0、1、2、3、4 或 5,

R²² 代表氢或 C₁-C₄ 烷基,

R²³ 代表氢或 C₁-C₄ 烷基,

R²⁴ 代表氢, 各自任选被氰基、卤素或 C₁-C₄ 烷氧基取代的 C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 烷基氨基或二 (C₁-C₄ 烷基) 氨基, 或者各自任选被氰基、卤素或 C₁-C₄ 烷基取代的 C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 环烷基氧基、C₃-C₆ 环烷基硫基或 C₃-C₆ 环烷基氨基,

R²⁵ 代表氢, 任选被氰基、羟基、卤素或 C₁-C₄ 烷氧基取代的 C₁-C₆ 烷基, 各自任选被氰基或卤素取代的 C₃-C₆ 烯基或 C₃-C₆ 炔基, 或任选被氰基、卤素或 C₁-C₄ 烷基取代的 C₃-C₆ 环烷基,

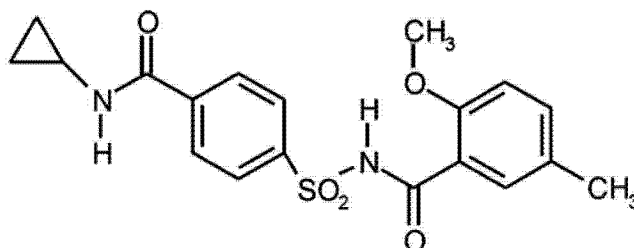
R²⁶ 代表氢, 任选被氰基、羟基、卤素或 C₁-C₄ 烷氧基取代的 C₁-C₆ 烷基, 各自任选被氰基或卤素取代的 C₃-C₆ 烯基或 C₃-C₆ 炔基, 任选被氰基、卤素或 C₁-C₄ 烷基取代的 C₃-C₆ 环烷基, 或者任选被硝基、氰基、卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基或 C₁-C₄ 卤代烷氧基取代的苯基, 或者与 R²⁵ 一起代表各自任选被 C₁-C₄ 烷基取代的 C₂-C₆ 烷二基或 C₂-C₅ 氧杂烷二基,

X^4 代表硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、甲酰基、氨基磺酰基、羟基、氨基、卤素、 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, 并且

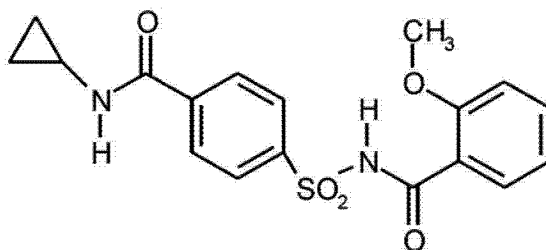
X^5 代表硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、甲酰基、氨基磺酰基、羟基、氨基、卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 卤代烷氧基。

10. 权利要求 9 的组合物, 其特征在于所述改进作物植物相容性的化合物选自以下化合物:

解草酯、解草唑、双苯噁唑酸、吡唑解草酯、解草恶唑、解草啉、苜草隆、杀草隆, 或化合物



和



11. 权利要求 9 或 10 的组合物, 其特征在于所述改进作物植物相容性的化合物为解草酯。

12. 权利要求 9 或 10 的组合物, 其特征在于所述改进作物植物相容性的化合物为吡唑解草酯。

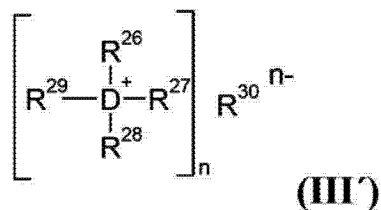
13. 用于防治不想要的植物的方法, 其特征在于使权利要求 9 的组合物作用于植物或其生境。

14. 权利要求 9 的组合物用于防治不想要的植物的用途。

15. 用于防治不想要的植物的方法, 其特征在于使权利要求 1 或 2 的式 (I) 化合物和权利要求 9 的改进作物植物相容性的化合物以时间上紧接的方式分别作用于植物或其环境。

16. 组合物, 含有

- 至少一种权利要求 1 或 2 的式 (I) 化合物, 或一种权利要求 9 的组合物, 和
- 至少一种式 (III') 的盐



其中

D 代表氮或磷,

R^{26} 、 R^{27} 、 R^{28} 和 R^{29} 相互独立地代表氢；或各自任选被取代的 C_1 - C_8 烷基，或者单不饱和或多不饱和的任选被取代的 C_1 - C_8 烯基，其中所述取代基可选自卤素、硝基和氰基，

n 代表 1、2、3 或 4，

R^{30} 代表一种无机或有机阴离子。

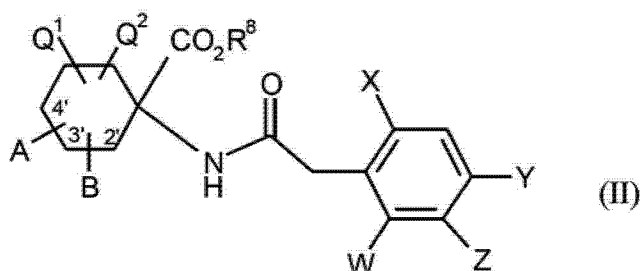
17. 权利要求 16 的组合物，其特征在于该组合物含有至少一种渗透剂。

18. 用于提高含有权利要求 1 或 2 的式 (I) 活性化合物或权利要求 9 的组合物杀虫剂和 / 或除草剂的活性的方法，其特征在于使用权利要求 16 的一种式 (III') 的盐制备即用型组合物。

19. 权利要求 18 的方法，其特征在于所述即用型组合物为喷洒液剂。

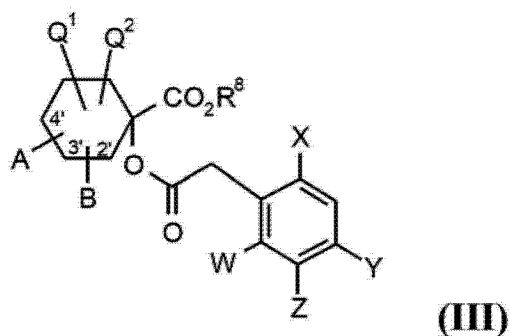
20. 权利要求 19 的方法，其特征在于所述喷洒液剂使用渗透剂制备。

21. 式 (II) 化合物



其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y、Z 和 R^8 具有权利要求 3 给出的含义。

22. 式 (III) 化合物



其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y、Z 和 R^8 具有权利要求 3 给出的含义。

氧杂螺环型螺取代的特特拉姆酸及特窗酸衍生物

[0001] 本发明涉及新的氧杂螺环型螺取代的特特拉姆酸(tetramic acid)和特窗酸衍生物,涉及其多种制备方法并涉及其用作杀虫剂和/或除草剂的用途。本发明还提供了这样的选择性除草组合物,其首先含有氧杂螺环型螺取代的特特拉姆酸和特窗酸衍生物并且其次含有一种改进作物植物相容性的化合物。

[0002] 本发明还涉及通过添加铵盐或磷盐及任选渗透剂来提高——含有特别是氧杂螺环型螺取代的特特拉姆酸和特窗酸衍生物的——作物保护组合物的作用,涉及相应的组合物、涉及其制备方法及其用于作物保护中作为杀虫剂和/或杀螨剂的应用以及/或者用于防止不想要的植物生长的应用。

[0003] 对于 3- 酰基吡咯烷 -2,4- 二酮的药学特性以前已有描述(S. Suzuki 等人 Chem. Pharm. Bull. 15 1120(1967))。此外, N- 苯基吡咯烷 -2,4- 二酮已由 R. Schmierer 和 H. Mildenberger 合成(Liebigs Ann. Chem. 1985, 1095)。对这些化合物的生物活性尚无描述。

[0004] EP-A-0 262 399 和 GB-A-2 266 888 公开了类似结构的化合物(3- 芳基吡咯烷 -2,4- 二酮),但是,未公开所述化合物的除草、杀虫或杀螨效果。具有除草、杀虫或杀螨作用的已知化合物为未被取代的双环的 3- 芳基吡咯烷 -2,4- 二酮衍生物(EP-A-355 599、EP-A-415 211 和 JP-A-12-0 53 670) 以及被取代的单环的 3- 芳基吡咯烷 -2,4- 二酮衍生物(EP-A-377893 和 EP-A-442 077)。

[0005] 其他已知的为多环的 3- 芳基吡咯烷 -2,4- 二酮衍生物(EP-A-442073) 和 1H- 芳基吡咯烷二酮衍生物(EP-A-456 063、EP-A-521 334、EP-A-596 298、EP-A-613 884、EP-A-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 97/02 243、WO 97/36 868、WO 97/43275、WO 98/05638、WO 98/06721、WO 98/25928、WO99/24437、WO 99/43649、WO 99/48869、WO 99/55673、WO 01/17972、WO 01/23354、WO 01/74770、WO 03/013249、WO 03/062244、WO2004/007448、WO 2004/024 688、WO 04/065366、WO 04/080962、WO04/111042、WO 05/044791、WO 05/044796、WO 05/048710、WO 05/049596、WO 05/066125、WO 05/092897、WO 06/000355、WO06/029799、WO 06/056281、WO 06/056282、WO 06/089633、WO07/048545、DEA 102 00505 9892、WO 07/073856、WO 07/096058、WO07/121868、WO 07/140881、DEA 102 00600 7882、DEA 102 00605 0148、DEA 102 00605 7036 和 DEA 102 00605 7037)。此外已知的为已知于 WO 99/16748 的缩酮取代的 1-H- 芳基吡咯烷 -2,4- 二酮以及已知于 JP-A-14 205 984 和 Ito M. 等人, Bioscience, Biotechnology and Biochemistry 67, 1230-1238, (2003) 的(螺)-缩酮取代的 N- 烷氧基烷氧基取代的芳基吡咯烷二酮。向酮-烯醇中添加安全剂也原则上已知于 WO03/013249。此外, WO 06/024411 公开了含有酮-烯醇的除草组合物。

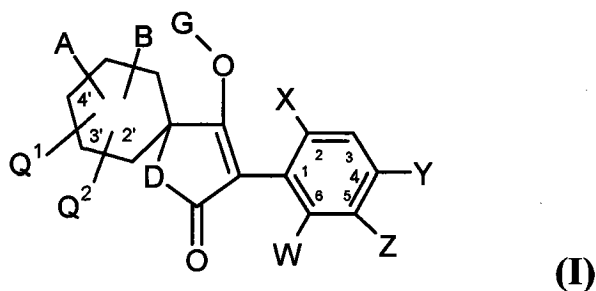
[0006] 已知某些 Δ^3 -二氢呋喃 -2- 酮衍生物具有除草、杀虫或杀螨特性:EP-A-528 156、EP-A-647 637、WO 95/26 954、WO 96/20 196、WO 96/25 395、WO 96/35 664、WO 97/01 535、WO 97/02 243、WO97/36 868、WO 98/05 638、WO 98/06 721、WO 99/16 748、WO 98/25 928、WO 99/43 649、WO 99/48 869、WO 99/55 673、WO 01/23354、WO 01/74 770、WO 01/17

972、WO 04/024 688、WO 04/080 962、WO 04/111 042、WO 05/092 897、WO 06/000 355、WO 06/029 799、WO 07/048545、WO 07/073856、WO 07/096058、DEA 102 00605 7036、DEA 102 00700 1866。

[0007] 但是, 已知化合物的除草和 / 或杀螨和 / 或杀虫的活性和 / 或活性谱和 / 或植物相容性, 特别是对作物植物的植物相容性, 并不总是都令人满意。

[0008] 本发明现提供新的式 (I) 化合物

[0009]



[0010] 其中

[0011] W 代表氢、烷基、烯基、炔基、任选被取代的环烷基、卤素、烷氧基、烯氧基、卤代烷基、卤代烷氧基或氰基,

[0012] X 代表卤素、烷基、烯基、炔基、任选被取代的环烷基、烷氧基、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、卤代烯氧基、硝基或氰基,

[0013] Y 和 Z 相互独立地代表氢、烷基、烯基、炔基、任选被取代的环烷基、烷氧基、卤素、卤代烷基、卤代烷氧基、氰基、硝基, 或者各自任选被取代的芳基或杂芳基,

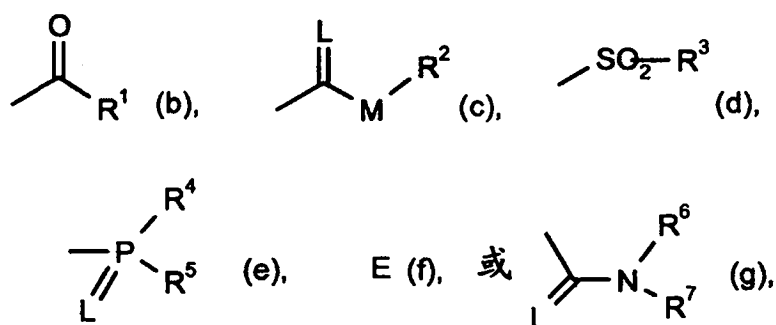
[0014] A 和 B 与它们所连接的碳原子代表一个四氢呋喃环或四氢吡喃环, 其各自任选被烷基、卤代烷基、烷氧基、烷氧基烷基或任选被取代的苯基取代,

[0015] D 代表 NH 或氧,

[0016] Q¹、Q² 相互独立地代表氢、烷基、卤代烷基或烷氧基,

[0017] G 代表氢 (a) 或代表以下基团之一

[0018]



[0019] 其中

[0020] E 代表一种金属离子或一种铵离子,

[0021] L 代表氧或硫,

[0022] M 代表氧或硫,

[0023] R¹ 代表各自任选被卤素或氰基取代的烷基、烯基、烷氧基烷基、烷硫基烷基或聚烷

氧基烷基,或者代表各自任选被卤素、烷基或烷氧基取代的环烷基或杂环基,或代表各自任选被取代的苯基、苯基烷基、杂芳基、苯氧基烷基或杂芳氧基烷基,

[0024] R^2 代表各自任选被卤素或氰基取代的烷基、烯基、烷氧基烷基或聚烷氧基烷基,或代表各自任选被取代的环烷基、苯基或苄基,

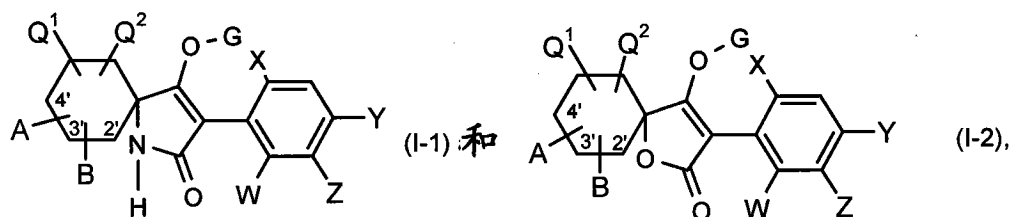
[0025] R^3 、 R^4 和 R^5 相互独立地代表各自任选被卤素取代的烷基、烷氧基、烷基氨基、二烷基氨基、烷硫基、烯硫基或环烷基硫基,或代表各自任选被取代的苯基、苄基、苯氧基或苯硫基,

[0026] R^6 和 R^7 相互独立地代表氢,代表各自任选被卤素或氰基取代的烷基、环烷基、烯基、烷氧基、烷氧基烷基,代表各自任选被取代的苯基或苄基,或与它们所连接的氮原子一起形成这样一个任选被取代的环,该环任选含有氧或硫。

[0027] 尤其是根据取代基的性质,式 (I) 化合物可以旋光异构体或不同组成的异构体混合物形式存在,如果合适,所述异构体混合物可以常规方式进行分离。本发明提供了纯的异构体和异构体混合物、其制备和用途,及含有它们的组合物。但是,为简便起见,下文仅称式 (I) 化合物,但其含义既指纯化合物,并且如果合适又指具有不同比例的异构体化合物的混合物。

[0028] 纳入 D 代表 NH(1) 和 D 代表 O(2),得到以下基本结构 (I-1) 至 (I-2):

[0029]

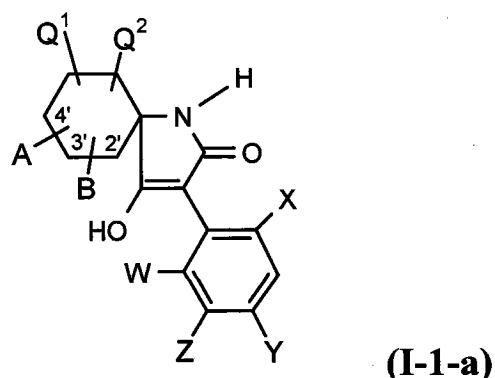


[0030] 其中

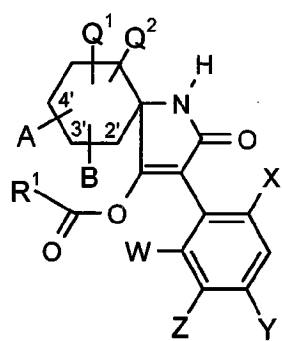
[0031] A、B、G、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义。

[0032] 纳入基团 G 的不同含义 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g),如果 D 代表 NH(1),则得到以下基本结构 (I-1-a) 至 (I-1-g),

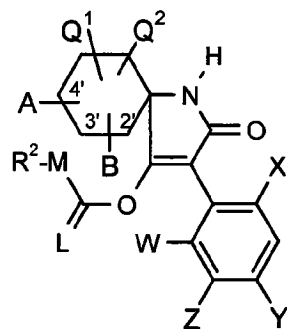
[0033]



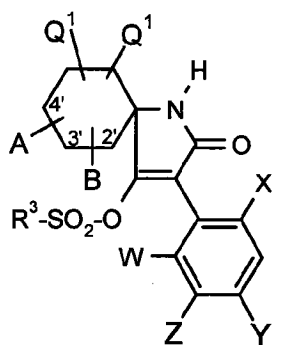
[0034]



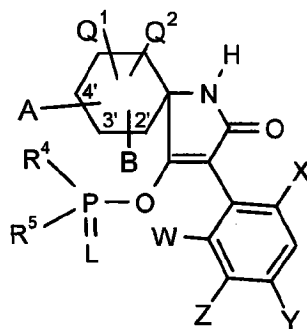
(I-1-b)



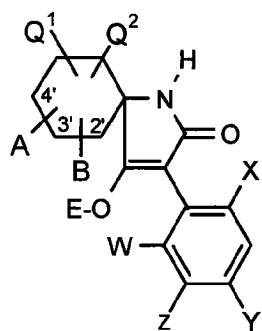
(I-1-c)



(I-1-d)

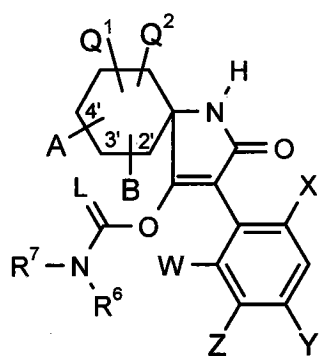


(I-1-e)



(I-1-f)

[0035]

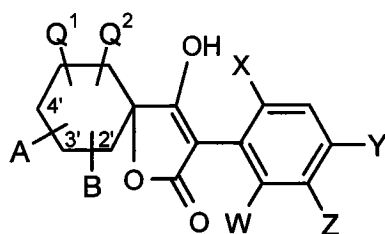
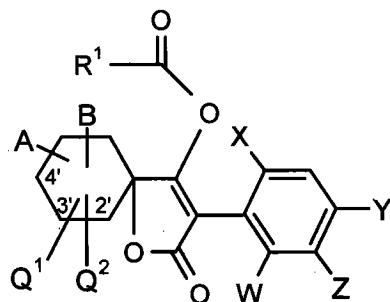
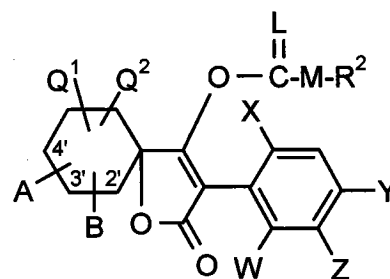
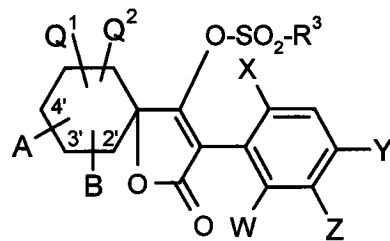
**(I-1-g)**

[0036] 其中

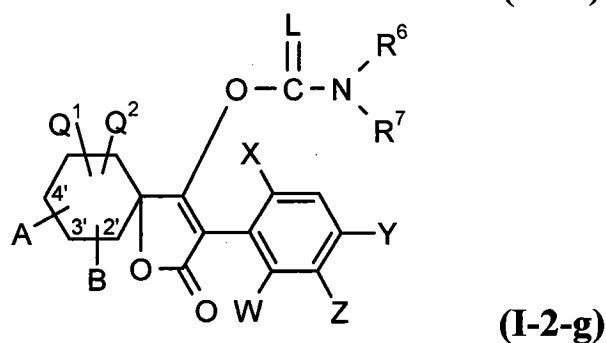
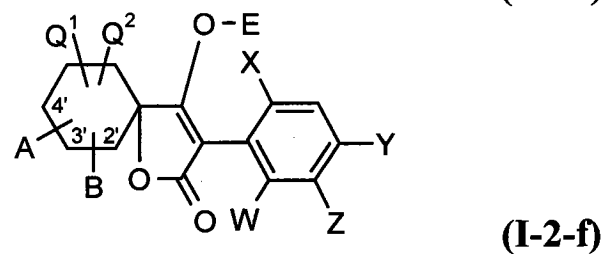
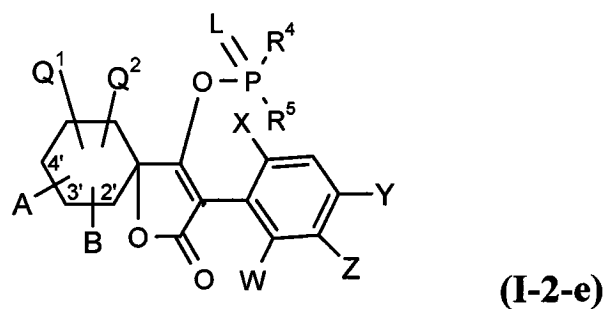
[0037] A、B、E、L、M、Q¹、Q²、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 和 R⁷ 具有上文给出的含义。

[0038] 纳入基团 G 的不同含义 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g), 如果 D 代表 O(2), 则得到以下基本结构 (I-2-a) 至 (I-2-g),

[0039]

**(I-2-a)****(I-2-b)****(I-2-c)****(I-2-d)**

[0040]



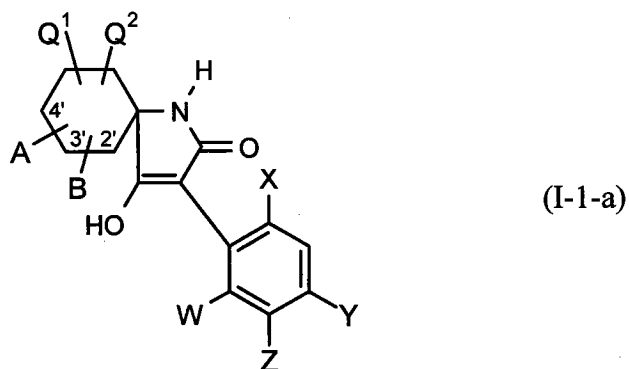
[0041] 其中

[0042] A、B、E、L、M、Q¹、Q²、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 和 R⁷ 具有上文给出的含义。

[0043] 此外,已发现,新的式(I)化合物通过下述方法之一获得:

[0044] (A) 当式(II)化合物在一种稀释剂的存在下且在一种碱的存在下进行分子内缩合时,获得式(I-1-a)化合物,

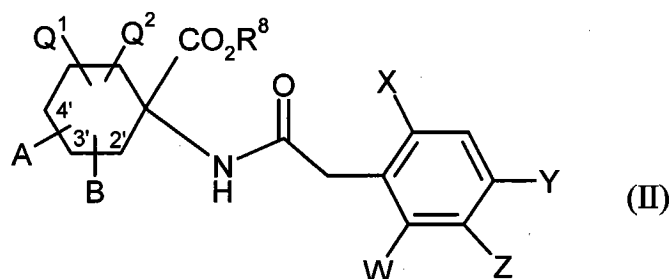
[0045]



[0046] 其中

[0047] A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义

[0048]



[0049] 其中

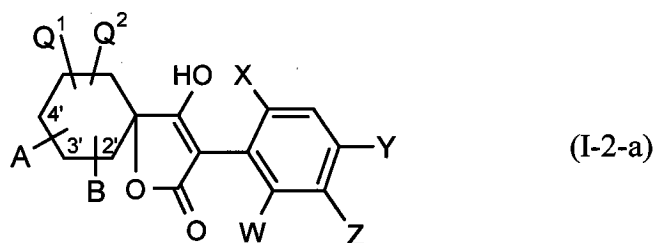
[0050] A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义，

[0051] 并且

[0052] R⁸ 代表烷基（优选 C₁-C₆ 烷基）。

[0053] (B) 此外，已发现，当式 (III) 化合物在一种稀释剂的存在下并在一种碱的存在下进行分子内缩合时，获得式 (I-2-a) 化合物，

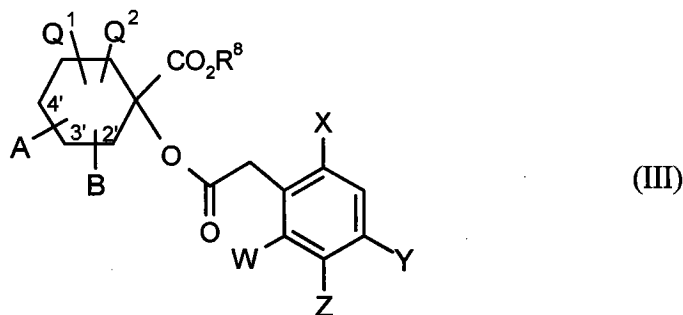
[0054]



[0055] 其中

[0056] A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义

[0057]



[0058] 其中

[0059] A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z 和 R⁸ 具有上文给出的含义。

[0060] 此外，已发现

[0061] (C) 当上文所示式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物——其中 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义——各自与下列化合物反应时，反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行，获得上文所示式 (I-1-b) 至 (I-2-b) 化合物，其中 R¹、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义，

[0062] α) 与式 (IV) 化合物反应

[0063]



[0064] 其中

[0065] R^1 具有上文给出的含义, 并且

[0066] Hal 代表卤素 (特别是氯或溴)

[0067] 或

[0068] β) 与式 (V) 的羧酸酐反应

[0069] $\text{R}^1\text{-CO-O-CO-R}^1$ (V)

[0070] 其中

[0071] R^1 具有上文给出的含义;

[0072] (D) 当上文所示式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物——其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义——各自与式 (VI) 的氯甲酸酯或氯甲酸硫代酸酯反应时, 反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行, 获得上文所示式 (I-1-c) 至 (I-2-c) 化合物, 其中 R^2 、A、B、 Q^1 、 Q^2 、M、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义并且 L 代表氧,

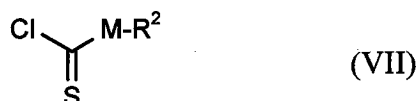
[0073] $\text{R}^2\text{-M-CO-Cl}$ (VI)

[0074] 其中

[0075] R^2 和 M 具有上文给出的含义;

[0076] (E) 当上文所示式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物——其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义——各自与式 (VII) 的氯单硫代甲酸酯或氯二硫代甲酸酯反应时, 反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行, 获得上文所示式 (I-1-c) 至 (I-2-c) 化合物, 其中 R^2 、A、B、 Q^1 、 Q^2 、M、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义并且 L 代表硫,

[0077]



[0078] 其中

[0079] M 和 R^2 具有上文给出的含义。

[0080] (F) 当上文所示式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物——其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义——各自与式 (VIII) 的磺酰氯反应时, 反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行, 获得上文所示式 (I-1-d) 至 (I-2-d) 的化合物, 其中 R^3 、A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义,

[0081] $\text{R}^3\text{-SO}_2\text{-Cl}$ (VIII)

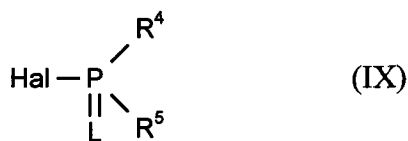
[0082] 其中

[0083] R^3 具有上文给出的含义,

[0084] (G) 当上文所示式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物——其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义——各自与式 (IX) 的磷化合物反应时, 反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行, 获得上文所示式 (I-1-e) 至 (I-2-e)

的化合物,其中 L、R⁴R⁵、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义,

[0085]

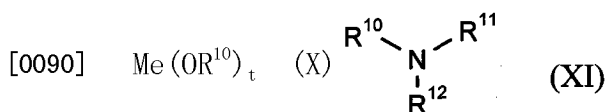


[0086] 其中

[0087] L、R⁴ 和 R⁵ 具有上文给出的含义,并且

[0088] Hal 代表卤素(特别是氯或溴),

[0089] (H) 当式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物——其中 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义——各自分别与式 (X) 的金属化合物或 (XI) 的胺进行反应时,反应如果合适在一种稀释剂的存在下进行,获得上文所示式 (I-1-f) 至 (I-2-f) 的化合物,其中 E、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义,



[0091] 其中

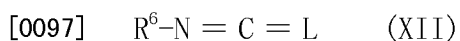
[0092] Me 代表一价或二价金属(优选一种碱金属或碱土金属,例如锂、钠、钾、镁或钙),

[0093] t 代表数值 1 或 2,并且

[0094] R¹⁰、R¹¹、R¹² 相互独立地代表氢或烷基(优选 C₁-C₈ 烷基),

[0095] (I) 当上文所示式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物——其中 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义——各自与下列物质反应时,获得上文所示式 (I-1-g) 至 (I-2-g) 的化合物,其中 L、R⁶、R⁷、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义,

[0096] α) 与式 (XII) 的异氰酸酯或异硫氰酸酯反应,反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种催化剂的存在下进行,



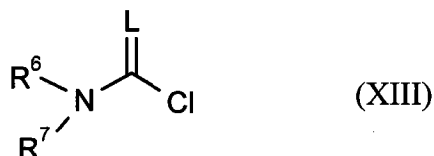
[0098] 其中

[0099] R⁶ 和 L 具有上文给出的含义,

[0100] 或

[0101] β) 与式 (XIII) 的氨基甲酰氯或硫代氨基甲酰氯反应,反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行,

[0102]

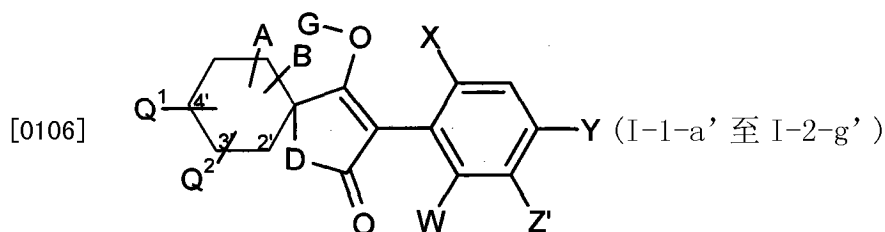


[0103] 其中

[0104] L、R⁶ 和 R⁷ 具有上文给出的含义,

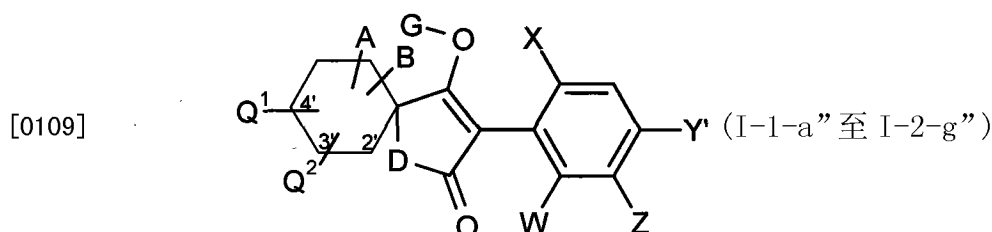
[0105] (J α) 当式 (I-1-a') 至 (I-2-g') 的化合物——其中 A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X 和 Y 具有上文给出的含义并且 Z' 优选代表溴或碘——与能够偶合的(杂)芳基衍生物,例如式 (XV α) 的苯基硼酸或其酯,在一种溶剂的存在下、一种催化剂(例如 Pd 复合物)的存在下

和一种碱（例如碳酸钠、磷酸钾）的存在下进行偶合时，获得上文所示式 (I-1a) 至 (I-2-g) 的化合物，其中 A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义，



[0107] 并且

[0108] (Jβ) 当式 (I-1-a'') 至 (I-2-g'') 的化合物——其中 A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X 和 Z 具有上文给出的含义并且 Y' 优选代表溴或碘——与能够偶合的（杂）芳基衍生物，例如式 (XVβ) 的苯基硼酸或其酯，在一种溶剂的存在下、一种催化剂（例如 Pd 复合物）和一种碱（例如碳酸钠、磷酸钾）的存在下进行偶合时，获得上文所示式 (I-1-a) 至 (I-2-g) 的化合物，其中 A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义，



[0110]



[0111] 此外，已发现新的式 (I) 化合物是极有效的农药，优选作为杀昆虫剂和 / 或杀螨剂和 / 或除草剂，并且另外还通常具有极好的植物耐受性，特别是作物植物耐受性。

[0112] 出人意料地，现还已发现，某些氧杂螺环型螺取代的特特拉姆酸和特窗酸衍生物，在与下文所述的改进作物植物相容性的化合物（安全剂 / 解毒剂）一起使用时，能有效防止对作物植物的损害，并且可以一种特别有利的方式用作广谱结合物制剂来对有益植物作物——例如谷物、以及玉米、大豆和稻——中的不想要植物进行选择性的防治。

[0113] 本发明还提供了含有有效量的活性化合物结合物的选择性除草组合物，所述活性化合物结合物含有组分：

[0114] (a') 至少一种式 (I) 化合物，其中 A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 定义如上

[0115] 和

[0116] (b') 至少一种选自以下化合物的改进作物植物相容性的化合物：

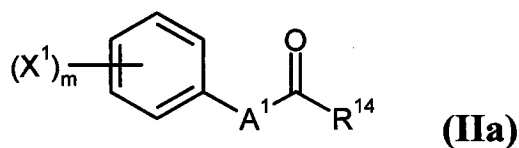
[0117] 4-二氯乙酰基-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷 (AD-67, MON-4660)、1-二氯乙酰基六氢-3,3,8a-三甲基吡咯并[1,2-a]嘧啶-6(2H)-酮 (dicyclonon, BAS-145138)、4-二氯乙酰基-3,4-二氢-3-甲基-2H-1,4-苯并噁嗪 (解草嗪 (benoxacor))、5-氯喹啉-8-氧基乙酸 1-甲基己基酯 (解草酯 (cloquintocet-mexyl)) - 另外参见 EP-A-86750、EP-A-94349、EP-A-191736、EP-A-492366 中的相关化合物)、3-(2-氯苄基)-1-(1-甲基-1-苯基乙基)脲 (苄草隆 (cumyluron))、α-(氰基甲氧亚氨基)-苯基乙腈 (解草胺腈 (cyometrinil))、2,

4-二氯苯氧基乙酸(2,4-D)、4-(2,4-二氯苯氧基)丁酸(2,4-DB)、1-(1-甲基-1-苯基乙基)-3-(4-甲基苯基)脲(杀草隆(daimuron, dymron))、3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸(麦草畏(dicamba))、S-1-甲基-1-苯基乙基哌啶-1-硫代羧酸酯(哌草丹(dimepiperate))、2,2-二氯-N-(2-氧代-2-(2-丙烯基氨基)乙基)-N-(2-丙烯基)乙酰胺(DKA-24)、2,2-二氯-N,N-二-2-丙烯基乙酰胺(烯丙酰草胺(dichlormid))、4,6-二氯-2-苯基嘧啶(解草啶(fenclorim))、1-(2,4-二氯苯基)-5-三氯甲基-1H-1,2,4-三唑-3-羧酸乙酯(解草唑(fenchlorazole-ethyl)-另外参见EP-A-174562和EP-A-346620中的相关化合物)、2-氯-4-三氟甲基噁唑-5-羧酸苯基甲基酯(解草胺(flurazole))、4-氯-N-(1,3-二氧戊环-2-基甲氧基)- α -三氟苯乙酮肟(氟草肟(fluxofenim))、3-二氯乙酰基-5-(2-呋喃基)-2,2-二甲基噁唑烷(解草恶唑(furilazole), MON-13900)、4,5-二氢-5,5-二苯基-3-异噁唑羧酸乙酯(双苯噁唑酸(isoxadifen-ethyl)-另外参见W0-A-95/07897中的相关化合物)、3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸1-(乙氧基羰基)乙酯(lactidichlor)、(4-氯-o-甲苯氧基)乙酸(MCPA)、2-(4-氯-o-甲苯氧基)丙酸(2甲4氯丙酸(mecoprop))、1-(2,4-二氯苯基)-4,5-二氢-5-甲基-1H-吡唑-3,5-二羧酸二乙酯(吡唑解草酯(mefenpyr-diethyl)-另外参见W0-A-91/07874中的相关化合物)、2-二氯甲基-2-甲基-1,3-二氧戊环(MG-191)、2-丙烯基-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷-4-二硫代羧酸酯(MG-838)、1,8-萘二甲酸酐、 α -(1,3-二氧戊环-2-基甲氧亚氨基)苯基乙腈(解草腈(oxabetrinil))、2,2-二氯-N-(1,3-二氧戊环-2-基甲基)-N-(2-丙烯基)乙酰胺(PPG-1292)、3-二氯乙酰基-2,2-二甲基噁唑烷(R-28725)、3-二氯乙酰基-2,2,5-三甲基噁唑烷(R-29148)、4-(4-氯-o-甲苯基)丁酸、4-(4-氯苯氧基)丁酸、二苯基甲氧基乙酸、二苯基甲氧基乙酸甲酯、二苯基甲氧基乙酸乙酯、1-(2-氯苯基)-5-苯基-1H-吡唑-3-羧酸甲酯、1-(2,4-二氯苯基)-5-甲基-1H-吡唑-3-羧酸乙酯、1-(2,4-二氯苯基)-5-异丙基-1H-吡唑-3-羧酸乙酯、1-(2,4-二氯苯基)-5-(1,1-二甲基乙基)-1H-吡唑-3-羧酸乙酯、1-(2,4-二氯苯基)-5-苯基-1H-吡唑-3-羧酸乙酯(另外参见EP-A-269806和EP-A-333131中的相关化合物)、5-(2,4-二氯苯基)-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯、5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯、5-(4-氟苯基)-5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯(另外参见W0-A-91/08202中的相关化合物)、5-氯喹啉-8-氧基乙酸1,3-二甲基丁-1-基酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸4-烯丙氧基丁基酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸1-烯丙氧基丙-2-基酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸甲酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸乙酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸烯丙酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸2-氧代丙-1-基酯、5-氯喹啉-8-氧基丙二酸二乙酯、5-氯喹啉-8-氧基丙二酸二烯丙酯、5-氯喹啉-8-氧基丙二酸二乙酯(另外参见EP-A-582198中的相关化合物)、4-羧基苯并二氢吡喃-4-基乙酸(AC-304415, 参见EP-A-613618)、4-氯苯氧基乙酸、3,3'-二甲基-4-甲氧基二苯甲酮、1-溴-4-氯甲基磺酰基苯、1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-3-甲基脲(也称为N-(2-甲氧基苯甲酰基)-4-[(甲基氨基羰基)氨基]苯磺酰胺)、1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-3,3-二甲基脲、1-[4-(N-4,5-二甲基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-3-甲基脲、1-[4-(N-萘基氨基磺酰基)苯基]-3,3-二甲基脲、N-(2-甲氧基-5-甲基苯甲酰基)-4-(环丙基氨基羰基)苯磺酰胺,

[0118] 和/或由以下通式定义的化合物之一:

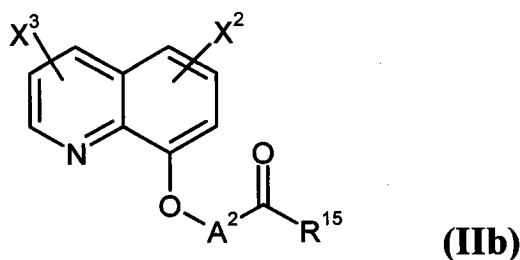
[0119] 通式 (IIa)

[0120]



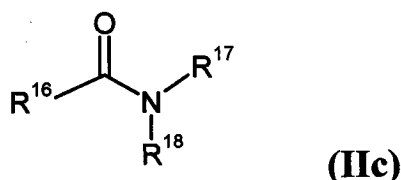
[0121] 或通式 (IIb)

[0122]



[0123] 或式 (IIc)

[0124]

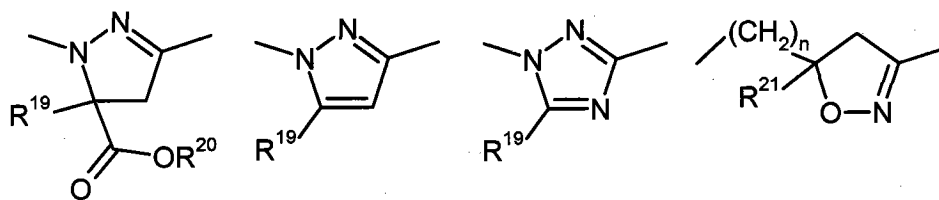


[0125] 其中

[0126] m 代表数值 0、1、2、3、4 或 5，

[0127] A¹ 代表以下所示二价杂环基之一，

[0128]



[0129] n 代表数值 0、1、2、3、4 或 5，

[0130] A² 代表任选被 C₁-C₄ 烷基和 / 或 C₁-C₄ 烷氧基 - 羰基和 / 或 C₁-C₄ 烯氧基 - 羰基取代的具有 1 或 2 个碳原子的烷二基，

[0131] R¹⁴ 代表羟基、巯基、氨基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 烷基氨基或二 (C₁-C₄ 烷基) 氨基，

[0132] R¹⁵ 代表羟基、巯基、氨基、C₁-C₇ 烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 烯氧基、C₁-C₆ 烯氧基 - C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 烷基氨基或二 (C₁-C₄ 烷基) 氨基，

[0133] R¹⁶ 代表任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C₁-C₄ 烷基，

[0134] R¹⁷ 代表氢、各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烯基或 C₂-C₆ 炔基，C₁-C₄ 烷氧基 - C₁-C₄ 烷基、二氧戊环基 - C₁-C₄ 烷基、呋喃基、呋喃基 - C₁-C₄ 烷基、噻吩基、噻唑基、嘧啶基，或者任选被氟、氯和 / 或溴或 C₁-C₄ 烷基取代的苯基，

[0135] R^{18} 代表氢、各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基或 C_2-C_6 炔基， C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基、二氧戊环基、 C_1-C_4 烷基、呋喃基、呋喃基、噻吩基、噻唑基、哌啶基，或者任选被氟、氯和 / 或溴或 C_1-C_4 烷基取代的苯基，

[0136] R^{17} 和 R^{18} 还一起代表各自任选被 C_1-C_4 烷基、苯基、呋喃基、稠合苯环取代或者被两个与其所连接的 C 原子一起形成一个 5 元或 6 元碳环的取代基取代的 C_3-C_6 烷二基或 C_2-C_5 氧杂烷二基，

[0137] R^{19} 代表氢、氰基、卤素，或者代表各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C_1-C_4 烷基、 C_3-C_6 环烷基或苯基，

[0138] R^{20} 代表氢、各自任选被羟基、氰基、卤素或 C_1-C_4 烷氧基取代的 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 环烷基或三 (C_1-C_4 烷基) 甲硅烷基，

[0139] R^{21} 代表氢、氰基、卤素，或者代表各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C_1-C_4 烷基、 C_3-C_6 环烷基或苯基，

[0140] X^1 代表硝基、氰基、卤素、 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，

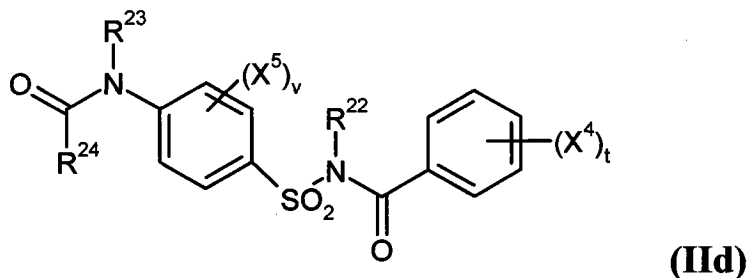
[0141] X^2 代表氢、氰基、硝基、卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 卤代烷氧基，

[0142] X^3 代表氢、氰基、硝基、卤素、 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，

[0143] 和 / 或由下列通式定义的化合物：

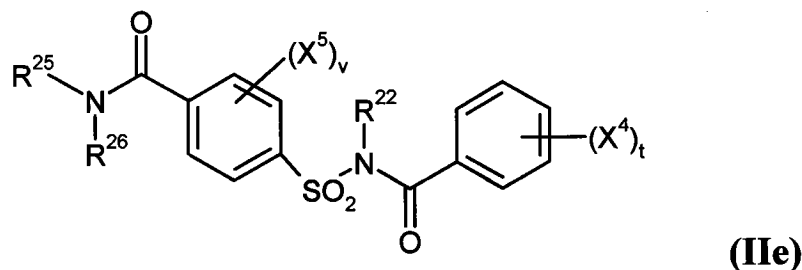
[0144] 通式 (IIId)

[0145]



[0146] 或通式 (IIe)

[0147]



[0148] 其中

[0149] t 代表数值 0、1、2、3、4 或 5，

[0150] v 代表数值 0、1、2、3、4 或 5，

[0151] R^{22} 代表氢或 C_1-C_4 烷基，

[0152] R^{23} 代表氢或 C_1-C_4 烷基,

[0153] R^{24} 代表氢,各自任选被氰基、卤素或 C_1-C_4 烷氧基取代的 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷基氨基或二 (C_1-C_4 烷基) 氨基,或者各自任选被氰基、卤素或 C_1-C_4 烷基取代的 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 环烷基氧基、 C_3-C_6 环烷基硫基或 C_3-C_6 环烷基氨基,

[0154] R^{25} 代表氢,任选被氰基、羟基、卤素或 C_1-C_4 烷氧基取代的 C_1-C_6 烷基,各自任选被氰基或卤素取代的 C_3-C_6 烯基或 C_3-C_6 炔基,或任选被氰基、卤素或 C_1-C_4 烷基取代的 C_3-C_6 环烷基,

[0155] R^{26} 代表氢,任选被氰基、羟基、卤素或 C_1-C_4 烷氧基取代的 C_1-C_6 烷基,各自任选被氰基或卤素取代的 C_3-C_6 烯基或 C_3-C_6 炔基,任选被氰基、卤素或 C_1-C_4 烷基取代的 C_3-C_6 环烷基,或者任选被硝基、氰基、卤素、 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,或者与 R^{25} 一起代表各自任选被 C_1-C_4 烷基取代的 C_2-C_6 烷二基或 C_2-C_5 氧杂烷二基,

[0156] X^4 代表硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、甲酰基、氨基磺酰基、羟基、氨基、卤素、 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,并且

[0157] X^5 代表硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、甲酰基、氨基磺酰基、羟基、氨基、卤素、 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。

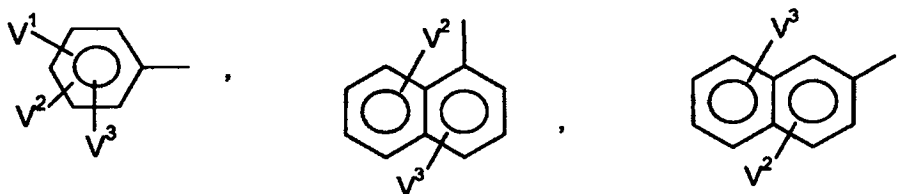
[0158] 式 (I) 提供了本发明化合物的宽泛定义。上下文所述式中所列基团的优选的取代基或范围示例说明如下:

[0159] W 优选代表氢、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基,代表任选被 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 烷氧基、氟、氯、三氟甲基或 C_3-C_6 环烷基单取代或二取代的 C_3-C_6 环烷基,代表卤素、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 卤代烷氧基或氰基,

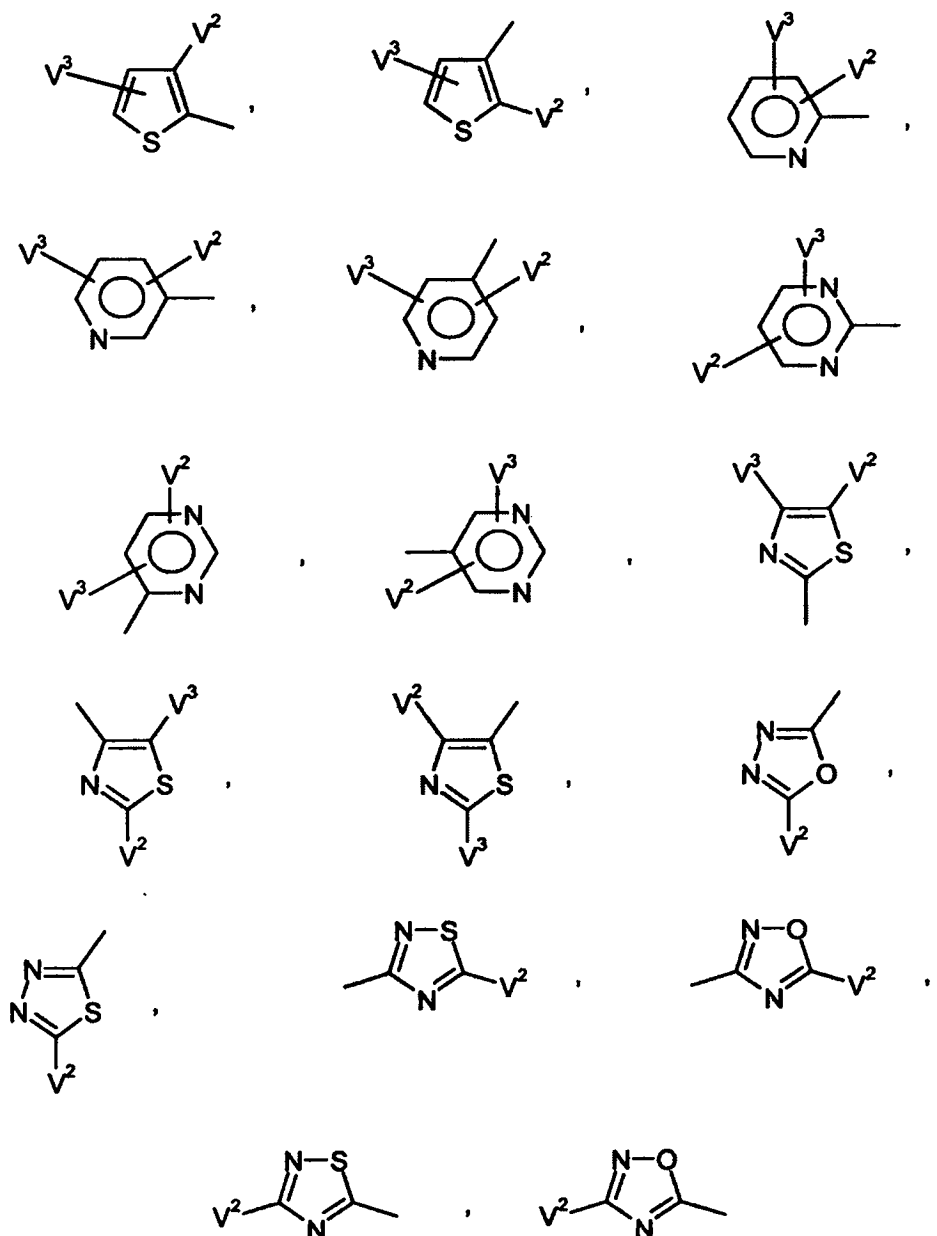
[0160] X 优选代表卤素、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基,代表任选被 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 烷氧基、氟、氯、三氟甲基或 C_3-C_6 环烷基单取代或二取代的 C_3-C_6 环烷基,代表 C_1-C_6 卤代烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_3-C_6 烯氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 烷基磺酰基、 C_1-C_6 卤代烷氧基、 C_3-C_6 卤代烯氧基、硝基或氰基,

[0161] Y 和 Z 相互独立地优选代表氢、卤素、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基,代表任选被 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 烷氧基、氟、氯、三氟甲基或 C_3-C_6 环烷基单取代或二取代的 C_3-C_6 环烷基,代表 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_1-C_6 卤代烷氧基、氰基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基,或代表以下 (杂) 芳基之一

[0162]



[0163]



[0164] 其中在（杂）芳基的情况下，基团 Y 或 Z 中只有一个可代表（杂）芳基，

[0165] V¹ 优选代表氢、卤素、C₁-C₁₂ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 烷基亚磺酰基、C₁-C₆ 烷基磺酰基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、硝基、氰基，或代表苯基、苯氧基、苯氧基 -C₁-C₄ 烷基、苯基 -C₁-C₄ 烷氧基、苯硫基 -C₁-C₄ 烷基或苯基 -C₁-C₄ 烷硫基，其各自任选被卤素、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、硝基或氰基单取代或多取代，

[0166] V² 和 V³ 相互独立地优选代表氢、卤素、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷基或 C₁-C₄ 卤代烷氧基，

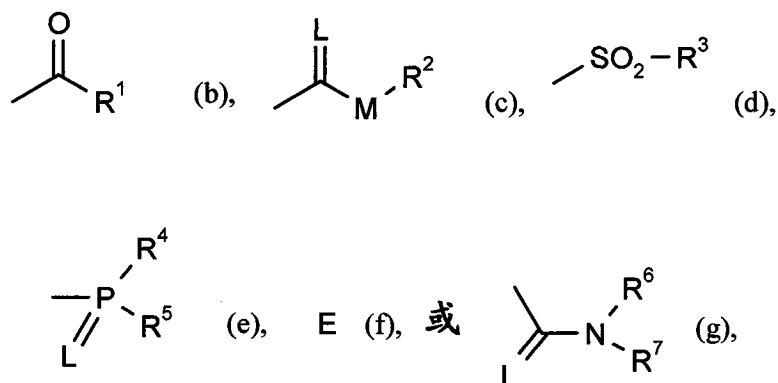
[0167] A 和 B 与它们所连接的碳原子（3' 位或 4' 位）优选代表一个任选被 C₁-C₆ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₆ 烷氧基或 C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基单取代或二取代的四氢呋喃环或四氢吡喃环，

[0168] D 优选代表 NH(1) 或氧 (2)，

[0169] Q^1 和 Q^2 相互独立地优选代表氢、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷基或 C_1 - C_4 烷氧基,

[0170] G 优选代表氢 (a) 或代表以下基团之一

[0171]



[0172] 其中

[0173] E 代表一种金属离子或一种铵离子,

[0174] L 代表氧或硫, 并且

[0175] M 代表氧或硫,

[0176] R^1 优选代表各自任选被卤素或氰基取代的 C_1 - C_{20} 烷基、 C_2 - C_{20} 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 烷基或聚- C_1 - C_8 烷氧基、 C_1 - C_8 烷基, 或代表任选被卤素、 C_1 - C_6 烷基或 C_1 - C_6 烷氧基取代的这样的 C_3 - C_8 环烷基, 该环烷基中任选一个或两个不直接相邻的亚甲基基团被氧和 / 或硫替代,

[0177] 代表任选被卤素、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,

[0178] 代表任选被卤素、硝基、氰基、 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,

[0179] 代表任选被卤素或 C_1 - C_6 烷基取代的具有一个或两个选自氧、硫和氮的杂原子的 5 元或 6 元杂芳基,

[0180] 代表任选被卤素或 C_1 - C_6 烷基取代的苯氧基- C_1 - C_6 烷基, 或

[0181] 代表任选被卤素、氨基或 C_1 - C_6 烷基取代的具有一个或两个选自氧、硫和氮的杂原子的 5 元或 6 元杂芳基氧基- C_1 - C_6 烷基,

[0182] R^2 优选代表各自任选被卤素或氰基取代的 C_1 - C_{20} 烷基、 C_2 - C_{20} 烯基、 C_1 - C_8 烷氧基、 C_2 - C_8 烷基或聚- C_1 - C_8 烷氧基- C_2 - C_8 烷基,

[0183] 代表任选被卤素、 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

[0184] 代表各自任选被卤素、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,

[0185] R^3 优选代表任选被卤素取代的 C_1 - C_8 烷基, 或者各自任选被卤素、 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,

[0186] R^4 和 R^5 相互独立地优选代表各自任选被卤素取代的 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 烷硫基或 C_3 - C_8 烯硫基, 或者代表各自任选被卤素、硝基、氰基、 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

C₁-C₄ 卤代烷基取代的苯基、苯氧基或苯硫基,

[0187] R⁶ 和 R⁷ 相互独立地优选代表氢, 各自任选被卤素或氰基取代的 C₁-C₈ 烷基、C₃-C₈ 环烷基、C₁-C₈ 烷氧基、C₃-C₈ 烯基或 C₁-C₈ 烷氧基 -C₂-C₈ 烷基, 代表各自任选被卤素、C₁-C₈ 烷基、C₁-C₈ 卤代烷基或 C₁-C₈ 烷氧基取代的苯基或苄基, 或一起代表一个任选被 C₁-C₆ 烷基取代的 C₃-C₆ 亚烷基基团, 其中任选一个亚甲基基团被氧或硫替代。

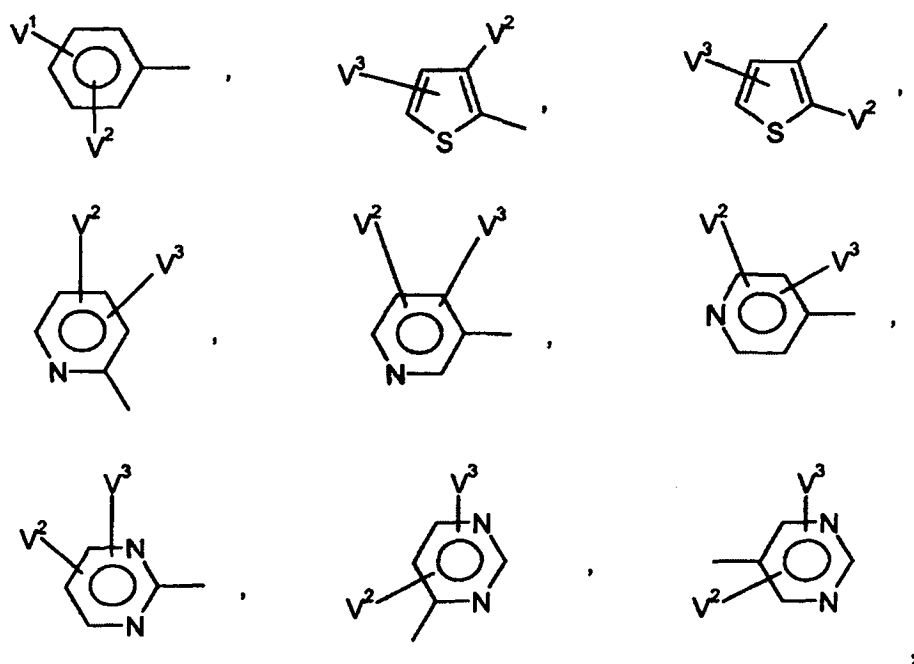
[0188] 在作为优选提及的基团定义中, 卤素代表氟、氯、溴和碘, 特别是氟、氯和溴。

[0189] W 特别优选代表氢、氯、溴、C₁-C₄ 烷基、C₂-C₄ 烯基、C₂-C₄ 炔基, 代表任选被甲基、乙基、甲氧基、氟、氯、三氟甲基或环丙基单取代的 C₃-C₆ 环烷基, 代表 C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₂ 卤代烷基或 C₁-C₂ 卤代烷氧基,

[0190] X 特别优选代表氯、溴、C₁-C₄ 烷基、C₂-C₄ 烯基、C₂-C₄ 炔基, 代表任选被甲基、乙基、甲氧基、氟、氯、三氟甲基或环丙基单取代的 C₃-C₆ 环烷基, 代表 C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 卤代烷氧基或氰基,

[0191] Y 和 Z 相互独立地特别优选代表氢、氟、氯、溴、碘、C₁-C₄ 烷基、C₂-C₄ 烯基、C₂-C₄ 炔基, 代表任选被甲基、乙基、甲氧基、氟、氯、三氟甲基或环丙基单取代的 C₃-C₆ 环烷基, 代表 C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、氰基、C₂-C₄ 烯基、C₂-C₄ 炔基, 或代表以下 (杂) 芳基基团之一

[0192]



[0193] 其中在 (杂) 芳基的情况, 基团 Y 或 Z 中只有一个可代表 (杂) 芳基,

[0194] V¹ 特别优选代表氢、氟、氯、溴、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₂ 卤代烷基、C₁-C₂ 卤代烷氧基、硝基、氰基, 或代表任选被氟、氯、溴、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₂ 卤代烷基、C₁-C₂ 卤代烷氧基、硝基或氰基单取代或二取代的苯基,

[0195] V² 和 V³ 相互独立地特别优选代表氢、氟、氯、溴、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₂ 卤代烷基或 C₁-C₂ 卤代烷氧基,

[0196] A 和 B 与它们所连接的碳原子 (3' 位或 4' 位) 特别优选代表一个任选被 C₁-C₄ 烷基、C₁-C₃ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基或 C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₂ 烷基单取代的四氢呋喃环或四氢吡

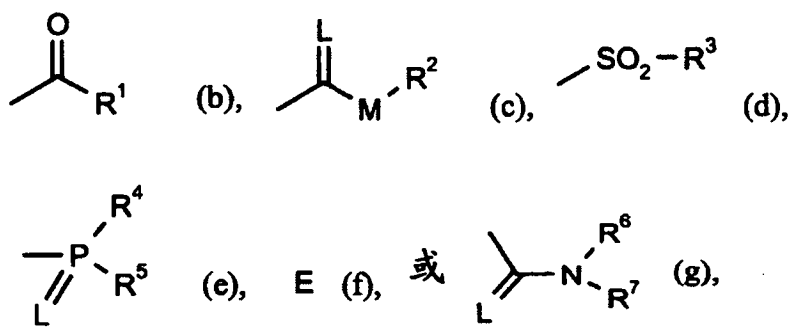
喃环,

[0197] D 特别优选代表 NH(1) 或氧 (2),

[0198] Q^1 和 Q^2 相互独立地特别优选代表氢、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基或乙氧基,

[0199] G 特别优选代表氢 (a) 或代表以下基团之一

[0200]



[0201] 其中

[0202] E 代表一种金属离子或一种铵离子,

[0203] L 代表氧或硫, 并且

[0204] M 代表氧或硫,

[0205] R^1 特别优选代表 C_1-C_{16} 烷基、 C_2-C_{16} 烯基、 C_1-C_6 烷氧基、 $-C_1-C_4$ 烷基、 C_1-C_6 烷硫基、 $-C_1-C_4$ 烷基或聚 $-C_1-C_6$ 烷氧基、 $-C_1-C_4$ 烷基, 其各自任选被氟或氯单取代至三取代; 或代表任选被氟、氯、 C_1-C_5 烷基或 C_1-C_5 烷氧基单取代或二取代的 C_3-C_7 环烷基, 并且其中任选一个或两个不直接相邻的亚甲基被氧和 / 或硫替代,

[0206] 代表任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基或 C_1-C_4 烷基磺酰基单取代至三取代的苯基,

[0207] 代表任选被氟、氯、溴、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷基或 C_1-C_3 卤代烷氧基单取代或二取代的苯基、 $-C_1-C_4$ 烷基,

[0208] 代表吡啶基、噻唑基、吡啶基、嘧啶基、呋喃基或噻吩基, 其各自任选被氟、氯、溴或 C_1-C_4 烷基单取代或二取代,

[0209] 代表任选被氟、氯、溴或 C_1-C_4 烷基单取代或二取代的苯氧基、 $-C_1-C_5$ 烷基, 或

[0210] 代表吡啶基氧基、 $-C_1-C_5$ 烷基、嘧啶基氧基、 $-C_1-C_5$ 烷基或噻唑基氧基、 $-C_1-C_5$ 烷基, 其各自任选被氟、氯、溴、氨基或 C_1-C_4 烷基单取代或二取代,

[0211] R^2 特别优选代表 C_1-C_{16} 烷基、 C_2-C_{16} 烯基、 C_1-C_6 烷氧基、 $-C_2-C_6$ 烷基或聚 $-C_1-C_6$ 烷氧基、 $-C_2-C_6$ 烷基, 其各自任选被氟或氯单取代至三取代,

[0212] 代表任选被氟、氯、 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 烷氧基单取代或二取代的 C_3-C_7 环烷基, 或

[0213] 代表各自任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷基或 C_1-C_3 卤代烷氧基单取代至三取代的苯基或苄基,

[0214] R^3 特别优选代表任选被氟或氯单取代至三取代的 C_1-C_6 烷基, 或代表各自任选被氟、氯、溴、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_2 卤代烷氧基、 C_1-C_2 卤代烷基、氰基或硝基单取代或二取代的苯基或苄基,

[0215] R^4 和 R^5 相互独立地特别优选代表 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷基氨基、

二-(C₁-C₆ 烷基) 氨基、C₁-C₆ 烷硫基或 C₃-C₄ 烯硫基, 其各自任选被氟或氯单取代至三取代; 或代表苯基、苯氧基或苯硫基, 其各自任选被氟、氯、溴、硝基、氰基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 卤代烷氧基、C₁-C₃ 烷硫基、C₁-C₃ 卤代烷硫基、C₁-C₃ 烷基或 C₁-C₃ 卤代烷基单取代或二取代,

[0216] R⁶ 和 R⁷ 相互独立地特别优选代表氢; 代表 C₁-C₆ 烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₃-C₆ 烯基或 C₁-C₆ 烷氧基 -C₂-C₆ 烷基, 其各自任选被氟或氯单取代至三取代; 代表苯基或苄基, 其各自任选被氟、氯、溴、C₁-C₅ 卤代烷基、C₁-C₅ 烷基或 C₁-C₅ 烷氧基单取代至三取代; 或一起代表一个任选被 C₁-C₄ 烷基取代的 C₃-C₆ 亚烷基基团, 其中任选一个亚甲基基团被氧或硫替代。

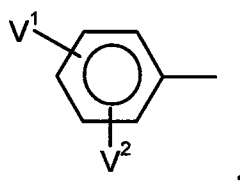
[0217] 在作为特别优选提及的基团定义中, 卤素代表氟、氯和溴, 特别是氟和氯。

[0218] W 极特别优选代表氢、氯、溴、甲基、乙基、乙烯基、乙炔基、丙炔基、环丙基、甲氧基、乙氧基或三氟甲基,

[0219] X 极特别优选代表氯、溴、甲基、乙基、丙基、异丙基、乙烯基、乙炔基、丙炔基、环丙基、甲氧基、乙氧基、三氟甲基、二氟甲氧基、三氟甲氧基或氰基,

[0220] Y 和 Z 相互独立地极特别优选代表氢、氟、氯、溴、碘、甲基、乙基、乙烯基、乙炔基、丙炔基、环丙基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或一个苯基基团

[0221]



[0222] 其中在苯基的情况下, 基团 Y 或 Z 中只有一个可代表苯基,

[0223] V¹ 极特别优选代表氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、三氟甲基或三氟甲氧基,

[0224] V² 极特别优选代表氢、氟、氯、甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基或三氟甲基,

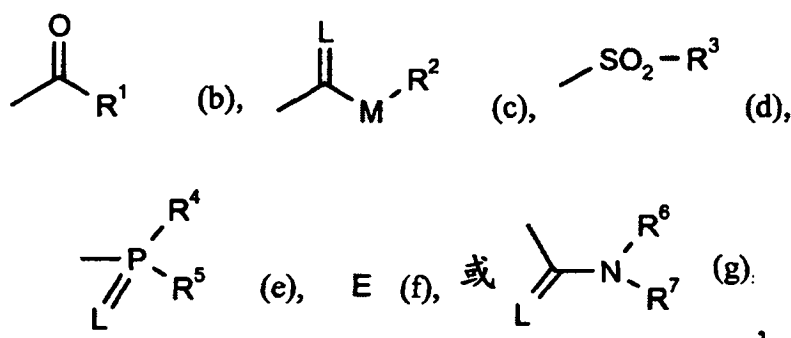
[0225] A 和 B 与它们所连接的碳原子 (3' 位或 4' 位) 极特别优选代表一个任选被甲基、乙基、丙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲氧基甲基或乙氧基甲基单取代的四氢呋喃环或四氢吡喃环,

[0226] D 极特别优选代表 NH(1) 或氧 (2),

[0227] Q¹ 和 Q² 极特别优选代表氢,

[0228] G 极特别优选代表氢 (a) 或代表以下基团之一

[0229]



[0230] 其中

[0231] E 代表一种金属离子或一种铵离子,

[0232] L 代表氧或硫, 并且

[0233] M 代表氧或硫,

[0234] R^1 极特别优选代表各自任选被氟或氯单取代至三取代的 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 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, 或代表任选被氟、氯、甲基、乙基或甲氧基单取代的 C_3 - C_6 环烷基,

[0235] 代表任选被氟、氯、溴、氰基、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单取代或二取代的苯基,

[0236] 代表各自任选被氯、溴或甲基单取代的呋喃基、噻吩基或吡啶基,

[0237] R^2 极特别优选代表各自任选被氟或氯单取代至三取代的 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基或 C_1 - C_4 烷氧基 - C_2 - C_4 烷基,

[0238] 代表环戊基或环己基, 或

[0239] 代表各自任选被氟、氯、氰基、硝基、甲基、乙基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基单取代或二取代的苯基或苄基,

[0240] R^3 极特别优选代表各自任选被氟或氯单取代至三取代的甲基、乙基、丙基或异丙基, 或代表任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、异丙基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、异丙氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或硝基单取代的苯基,

[0241] R^4 和 R^5 相互独立地极特别优选代表 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 烷硫基, 或代表各自任选被氟、氯、溴、硝基、氰基、甲基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基单取代的苯基、苯氧基或苯硫基,

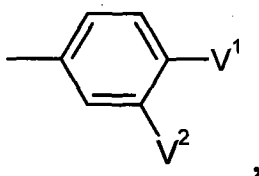
[0242] R^6 和 R^7 相互独立地极特别优选代表氢; 代表 C_1 - C_4 烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_3 - C_4 烯基或 C_1 - C_4 烷氧基 - C_2 - C_4 烷基; 代表任选被氟、氯、溴、甲基、甲氧基或三氟甲基单取代或二取代的苯基; 或一起代表一个 C_5 - C_6 亚烷基基团, 其中任选一个亚甲基基团被氧或硫替代。

[0243] W 尤其优选代表氢、氯、溴、甲基、乙基或甲氧基,

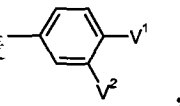
[0244] X 尤其优选代表氯、溴、甲基、乙基或甲氧基,

[0245] Y 和 Z 相互独立地尤其优选代表氢、氯、溴、甲基, 或代表基团

[0246]



[0247] 其中在此情况下,基团 Y 或 Z 中只有一个可代表



[0248] V^1 尤其优选代表氟或氯,

[0249] V^2 尤其优选代表氢、氟或氯,

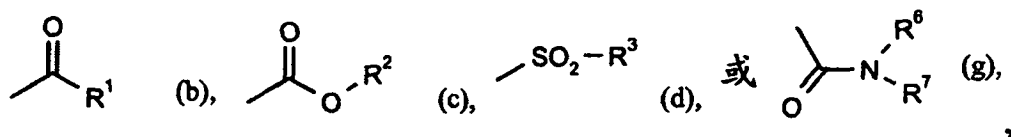
[0250] A 和 B 与它们所连接的碳原子 (4' 位) 尤其优选代表一个任选被甲基、乙基、丙基或甲氧基甲基单取代的四氢呋喃环,

[0251] D 尤其优选代表 NH(1) 或氧 (2),

[0252] Q^1 和 Q^2 尤其优选代表氢,

[0253] G 尤其优选代表氢 (a) 或代表以下基团之一

[0254]



[0255] R^1 尤其优选代表 C_1 - C_{10} 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_2 烷基、 C_3 - C_6 环烷基,

[0256] 代表任选被氯单取代的苯基,或代表噻吩基,

[0257] R^2 尤其优选代表 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基,或代表苄基,

[0258] R^3 尤其优选代表甲基,

[0259] R^6 和 R^7 一起尤其优选代表一个 C_5 - C_6 亚烷基基团,其中任选一个亚甲基基团被氧或硫替代。

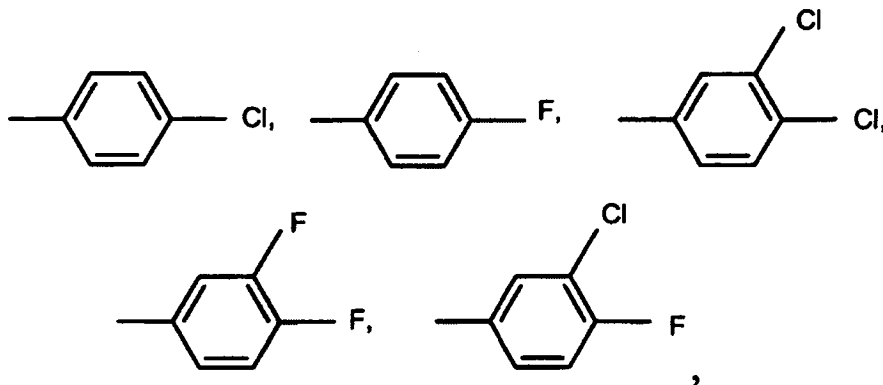
[0260] W 极尤其优选代表氢、氯、溴、甲基或乙基,

[0261] X 极尤其优选代表氯、溴、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基或环丙基,

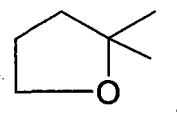
[0262] Y 极尤其优选代表氢、甲基、乙基、氯、溴、碘、氟、三氟甲氧基或环丙基,

[0263] Z 极尤其优选代表氢、溴、甲基或基团

[0264]



[0265] A 和 B 与它们所连接的碳原子 (4' 位) 极尤其优选代表

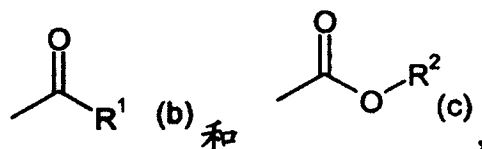


[0266] D 极尤其优选代表 NH(1) 或氧 (2),

[0267] Q^1 和 Q^2 极尤其优选代表氢,

[0268] G 极尤其优选代表氢 (a) 或以下基团之一

[0269]



[0270] R^1 极尤其优选代表 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 $-C_1-C_2$ 烷基或环丙基,

[0271] R^2 极尤其优选代表 C_1-C_6 烷基或苄基。

[0272] 上述宽泛或优选的基团定义或示例说明可按需要相互结合,即包括各范围和优选范围之间的结合。它们既适用于终产物,也相应地适用于前体和中间体。

[0273] 本发明优选含有上文作为优选所列的(优选的)含义的结合的式(I)化合物。

[0274] 本发明特别优选含有上文作为特别优选所列的含义的结合的式(I)化合物。

[0275] 本发明极特别优选含有上文作为极特别优选所列的含义的结合的式(I)化合物。

[0276] 本发明尤其优选含有上文作为尤其优选所列的含义的结合的式(I)化合物。

[0277] 强调其中 G 代表氢的式(I)化合物。

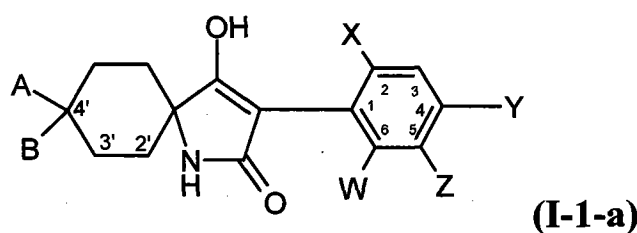
[0278] 饱和的或不饱和的烃基,例如烷基、烷二基或烯基,只要可能,可各自为直链或带有支链的,其中烃基包括与杂原子的结合,例如,烷氧基。

[0279] 除非另有指明,任选被取代的基团可为单取代的或多取代的,其中在多取代的情况下,取代基可以相同或不同。

[0280] 除在制备实施例中提及的化合物之外,可特别提及以下式(I-1-a)化合物:

[0281] 表 1

[0282]

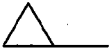
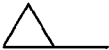
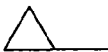


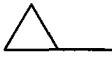
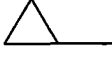
[0283]

A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH₂)₃-	CH₃	H	H	H
-O-(CH₂)₃-	Br	H	H	H
-O-(CH₂)₃-	Cl	H	H	H
-O-(CH₂)₃-	CF₃	H	H	H
-O-(CH₂)₃-	OCH₃	H	H	H
-O-(CH₂)₃-	Br	H	Cl	H
-O-(CH₂)₃-	Cl	H	Br	H
-O-(CH₂)₃-	Cl	H	Cl	H
-O-(CH₂)₃-	Cl	H	CH₃	H
-O-(CH₂)₃-	CH₃	H	Cl	H
-O-(CH₂)₃-	Cl	Cl	H	H
-O-(CH₂)₃-	Cl	OCH₃	H	H
-O-(CH₂)₃-	Cl	CH₃	H	H

A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	OC ₂ H ₅	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	OCH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	CH ₃	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	Br	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	Br	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H
[0284] -O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Cl	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Br	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Cl	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Br	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	CH ₃	Cl	H

A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	C ₂ H ₅	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₂ H ₅	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	OCH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	OC ₂ H ₅	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	Cl	Cl
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	Cl	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	H	Cl	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	H	CH ₃	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	Br	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	Cl	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	Br	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	CH ₃	Cl
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	H	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	H	H	CH ₃
[0285] -O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	Cl
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	Br
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	F
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	Cl
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	Br
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	Cl	H	Br
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl-C ₆ H ₄
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄
-O-(CH ₂) ₃ -	I	H	H	H

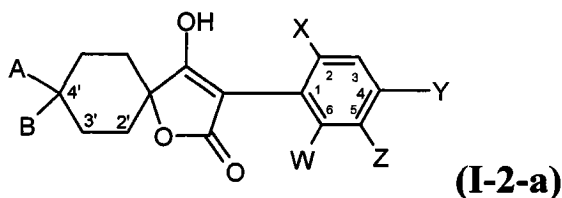
A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -	I	H	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	I	CH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	I	C ₂ H ₅	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	I
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	CH ₃	I
-O-(CH ₂) ₃ -	I	CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	I	C ₂ H ₅	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	I	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	I	C ₂ H ₅	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	I	Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	I	H	CH ₃	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	I	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	H	I	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	I	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	I	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	I	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	I	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	C ₂ H ₅	I	H
[0286] -O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	I	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	I
-O-(CH ₂) ₃ -	I	H	H	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	H	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -		H	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -		H	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -		C ₂ H ₅	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -		C ₂ H ₅	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -		C ₂ H ₅	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -		Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H		H

A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	H		H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃		H
[0287] -O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃		H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅		H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃		H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	C ₂ H ₅		H

[0288] 除制备实施例中提及的化合物外,可特别提及以下式 (I-2-a) 的化合物:

[0289] 表 2

[0290]



[0291]

A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	H	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CF ₃	H	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	H	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	H	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	Cl	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	OCH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	OC ₂ H ₅	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	OCH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H

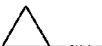
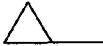
[0292]

A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	CH ₃	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	Br	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	Br	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Cl	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Br	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Cl	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Br	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	C ₂ H ₅	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₂ H ₅	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	OCH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	OC ₂ H ₅	CH ₃	H

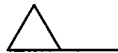
[0293]

A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	Cl	Cl
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	Cl	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	H	Cl	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	H	CH ₃	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	Br	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	Cl	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	Br	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	CH ₃	Cl
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	H	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	H	H	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	Cl
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	Br
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	F
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	Cl
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	Br
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	Cl	H	Br
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl-C ₆ H ₄
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄
-O-(CH ₂) ₃ -	I	H	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	I	H	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	I	CH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	I	C ₂ H ₅	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	I
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	CH ₃	I

[0294]

A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -	I	CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	I	C ₂ H ₅	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	I	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	I	C ₂ H ₅	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	I	Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	I	H	CH ₃	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	I	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	H	I	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	I	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	I	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	I	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	I	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	C ₂ H ₅	I	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	I	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	I
-O-(CH ₂) ₃ -	I	H	H	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -		H	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -		H	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -		C ₂ H ₅	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -		C ₂ H ₅	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -		C ₂ H ₅	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -		Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H		H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	H		H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃		H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃		H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅		H

[0295]

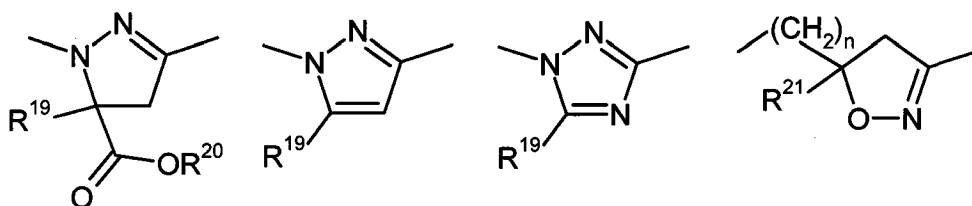
A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃		H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	C ₂ H ₅		H

[0296] 上文所列与式 (IIa)、(IIb)、(IIc)、(IId) 和 (IIe) 的改进作物植物相容性的化合物 (“除草剂安全剂”) 有关的基团的优选定义在下面进行限定。

[0297] m 优选代表数值 0、1、2、3 或 4。

[0298] A¹ 优选代表以下所示二价杂环基团之一

[0299]



[0300] n 优选代表数值 0、1、2、3 或 4。

[0301] A² 优选代表各自任选被甲基、乙基、甲氧基羰基、乙氧基羰基或烯丙氧基羰基取代的亚甲基或亚乙基。

[0302] R¹⁴ 优选代表羟基、巯基、氨基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基或叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、正丙硫基或异丙硫基、正丁硫基、异丁硫基、仲丁硫基或叔丁硫基、甲氨基、乙氨基、正丙氨基或异丙氨基、正丁氨基、异丁氨基、仲丁氨基或叔丁氨基、二甲氨基或二乙氨基。

[0303] R¹⁵ 优选代表羟基、巯基、氨基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基或叔丁氧基、1-甲基己氧基、烯丙氧基、1-烯丙氧基甲基乙氧基、甲硫基、乙硫基、正丙硫基或异丙硫基、正丁硫基、异丁硫基、仲丁硫基或叔丁硫基、甲氨基、乙氨基、正丙氨基或异丙氨基、正丁氨基、异丁氨基、仲丁氨基或叔丁氨基、二甲氨基或二乙氨基。

[0304] R¹⁶ 优选代表各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基。

[0305] R¹⁷ 优选代表氢；各自任选被氟和 / 或氯取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基乙基、二氧戊环基甲基、呋喃基、呋喃基甲基、噻吩基、噻唑基、哌啶基；或任选被氟、氯、甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基取代的苯基。

[0306] R¹⁸ 优选代表氢；各自任选被氟和 / 或氯取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基乙基、二氧戊环基甲基、呋喃基、呋喃基甲基、噻吩基、噻唑基、哌啶基；或任选被氟、氯、甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基取代的苯基；或与 R¹⁷ 一起代表任选被甲基、乙基、呋喃基、苯基、稠合苯环或被两个与它们所连接的 C 原子一起形成一个 5 元或 6 元碳环的取代基取代的基团 -CH₂-O-CH₂-CH₂- 和 -CH₂-CH₂-O-CH₂-CH₂- 中的一个。

[0307] R^{19} 优选代表氢、氰基、氟、氯、溴,或代表各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基或苯基。

[0308] R^{20} 优选代表氢,各自任选被羟基、氰基、氟、氯、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基。

[0309] R^{21} 优选代表氢、氰基、氟、氯、溴,或代表各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基或苯基。

[0310] X^1 优选代表硝基、氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、二氟甲基、二氯甲基、三氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、氟二氯甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基。

[0311] X^2 优选代表氢、硝基、氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、二氟甲基、二氯甲基、三氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、氟二氯甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基。

[0312] X^3 优选代表氢、硝基、氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、二氟甲基、二氯甲基、三氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、氟二氯甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基。

[0313] t 优选代表数值 0、1、2、3 或 4。

[0314] v 优选代表数值 0、1、2、3 或 4。

[0315] R^{22} 优选代表氢、甲基、乙基、正丙基或异丙基。

[0316] R^{23} 优选代表氢、甲基、乙基、正丙基或异丙基。

[0317] R^{24} 优选代表氢;各自任选被氰基、氟、氯、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基或叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、正丙硫基或异丙硫基、正丁硫基、异丁硫基、仲丁硫基或叔丁硫基、甲氨基、乙氨基、正丙氨基或异丙氨基、正丁氨基、异丁氨基、仲丁氨基或叔丁氨基、二甲氨基或二乙氨基;或各自任选被氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环丙基氧基、环丁基氧基、环戊基氧基、环己基氧基、环丙基硫基、环丁基硫基、环戊基硫基、环己基硫基、环丙基氨基、环丁基氨基、环戊基氨基或环己基氨基。

[0318] R^{25} 优选代表氢;各自任选被氰基、羟基、氟、氯、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基或仲丁基;各自任选被氰基、氟、氯或溴取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基;或者各自任选被氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基。

[0319] R^{26} 优选代表氢;各自任选被氰基、羟基、氟、氯、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基或仲丁基;各自任选被氰基、氟、氯或溴取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基;各自任选被氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基;或者任选被硝基、氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基取代的苯基;或与 R^{25} 一起代表各自任选被甲基或乙基取代的丁 -1,4- 二基 (三亚甲基)、戊 -1,5- 二基、1- 氧杂丁 -1,4- 二基或 3- 氧

杂戊-1,5-二基。

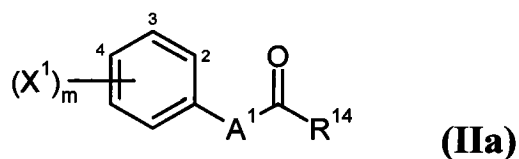
[0320] X^4 优选代表硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、甲酰基、氨基磺酰基、羟基、氨基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基。

[0321] X^5 优选代表硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、甲酰基、氨基磺酰基、羟基、氨基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基。

[0322] 本发明极特别优选的作为除草剂安全剂的式 (IIa) 化合物的实例列于下表中。

[0323] 表式 (IIa) 化合物的实例

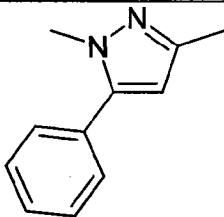
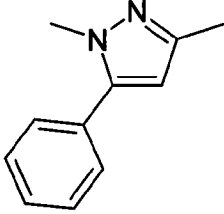
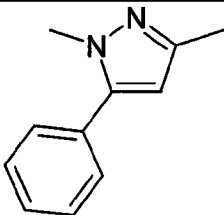
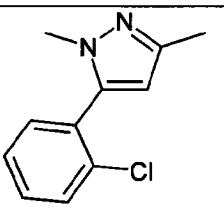
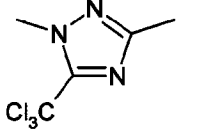
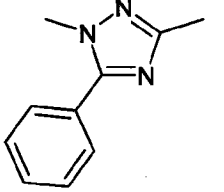
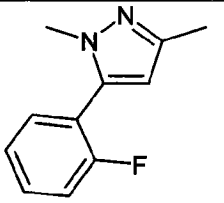
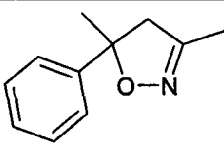
[0324]



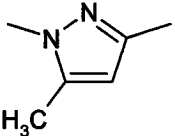
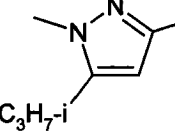
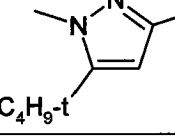
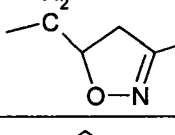
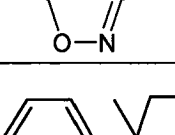
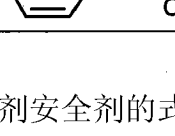
[0325]

实例序号	(位置) (X^1) _m	A^1	R^{14}
IIa-1	(2) Cl, (4) Cl		OCH₃
IIa-2	(2) Cl, (4) Cl		OCH₃
IIa-3	(2) Cl, (4) Cl		OC₂H₅
IIa-4	(2) Cl, (4) Cl		OC₂H₅

[0326]

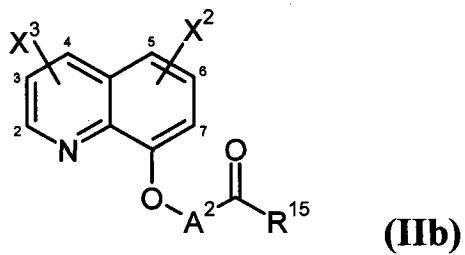
实例序号	(位置) (X) _m	A ¹	R ¹⁴
IIa-5	(2) Cl		OCH ₃
IIa-6	(2) Cl, (4) Cl		OCH ₃
IIa-7	(2) F		OCH ₃
IIa-8	(2) F		OCH ₃
IIa-9	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-10	(2) Cl, (4) CF ₃		OCH ₃
IIa-11	(2) Cl		OCH ₃
IIa-12	-		OC ₂ H ₅

[0327]

实例序号	(位置) (X ¹) _m	A ¹	R ¹⁴
IIa-13	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-14	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-15	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-16	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-17	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-18	-		OH

[0328] 本发明极特别优选的作为除草剂安全剂的式 (IIb) 化合物的实例列于下表中。

[0329]



[0330] 表式 (IIb) 化合物的实例

[0331]

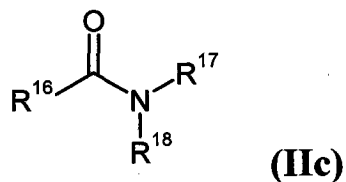
实例序号	(位置) X^2	(位置) X^3	A^2	R^{15}
IIb-1	(5) Cl	-	CH_2	OH
IIb-2	(5) Cl	-	CH_2	OCH_3
IIb-3	(5) Cl	-	CH_2	OC_2H_5
IIb-4	(5) Cl	-	CH_2	OC_3H_7-n
IIb-5	(5) Cl	-	CH_2	OC_3H_7-i

[0332]

实例序号	(位置) X^2	(位置) X^3	A^2	R^{15}
IIb-6	(5) Cl	-	CH_2	OC_4H_9-n
IIb-7	(5) Cl	-	CH_2	$OCH(CH_3)C_5H_{11-n}$
IIb-8	(5) Cl	(2) F	CH_2	OH
IIb-9	(5) Cl	(2) Cl	CH_2	OH
IIb-10	(5) Cl	-	CH_2	$OCH_2CH=CH_2$
IIb-11	(5) Cl	-	CH_2	OC_4H_9-i
IIb-12	(5) Cl	-	CH_2	
IIb-13	(5) Cl	-		$OCH_2CH=CH_2$
IIb-14	(5) Cl	-		OC_2H_5
IIb-15	(5) Cl	-		OCH_3

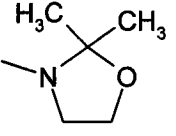
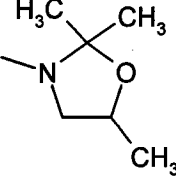
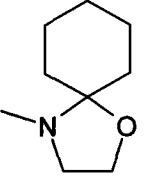
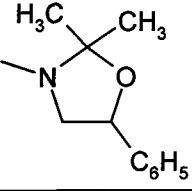
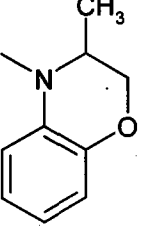
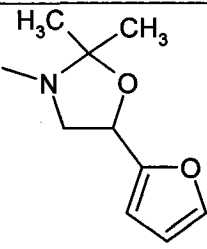
[0333] 本发明极特别优选的作为除草剂安全剂的式 (IIc) 化合物的实例列于下表中。

[0334]

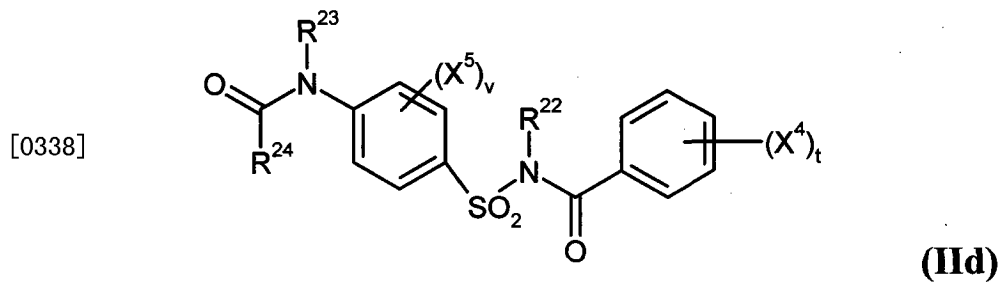


[0335] 表式 (IIc) 化合物的实例

[0336]

实例序号	R ¹⁶	N(R ¹⁷ , R ¹⁸)
IIc-1	CHCl ₂	N(CH ₂ CH=CH ₂) ₂
IIc-2	CHCl ₂	
IIc-3	CHCl ₂	
IIc-4	CHCl ₂	
IIc-5	CHCl ₂	
IIc-6	CHCl ₂	
IIc-7	CHCl ₂	

[0337] 本发明极特别优选的作为除草剂安全剂的式 (IIId) 化合物的实例列于下表中。

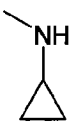


[0339] 表 式 (IIId) 化合物的实例

[0340]

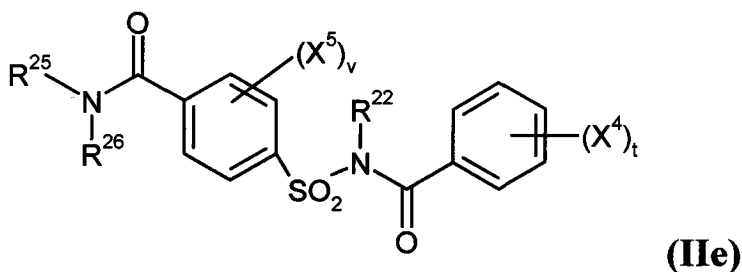
实例序号	R ²²	R ²³	R ²⁴	(位置) (X ⁴) _t	(位置) (X ⁵) _v
II d-1	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃	-
II d-2	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃	-
II d-3	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃	-
II d-4	H	H	C ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃	-
II d-5	H	H		(2) OCH ₃	-
II d-6	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
II d-7	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
II d-8	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
II d-9	H	H	C ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
II d-10	H	H		(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
II d-11	H	H	OCH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
II d-12	H	H	OC ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
II d-13	H	H	OC ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
II d-14	H	H	SCH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
II d-15	H	H	SC ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
II d-16	H	H	SC ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
II d-17	H	H	NHCH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
II d-18	H	H	NHC ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
II d-19	H	H	NHC ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-

[0341]

实例序号	R ²²	R ²³	R ²⁴	(位置) (X ⁴) _t	(位置) (X ⁵) _v
IIId-20	H	H		(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIId-21	H	H	NHCH ₃	(2) OCH ₃	-
IIId-22	H	H	NHC ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃	-
IIId-23	H	H	N(CH ₃) ₂	(2) OCH ₃	-
IIId-24	H	H	N(CH ₃) ₂	(3) CH ₃ (4) CH ₃	-
IIId-25	H	H	CH ₂ -O-CH ₃	(2) OCH ₃	-

[0342] 本发明极特别优选的作为除草剂安全剂的式 (IIe) 化合物的实例列于下表中。

[0343]



[0344] 表式 (IIe) 化合物的实例

[0345]

实例序号	R ²²	R ²⁵	R ²⁶	(位置) (X ⁴) _t	(位置) (X ⁵) _v
IIe-1	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃	-
IIe-2	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃	-
IIe-3	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃	-
IIe-4	H	H	C ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃	-
IIe-5	H	H		(2) OCH ₃	-
IIe-6	H	CH ₃	CH ₃	(2) OCH ₃	-
IIe-7	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIe-8	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIe-9	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-

[0346]

实例序号	R ²²	R ²⁵	R ²⁶	(位置) (X ⁴) _t	(位置) (X ⁵) _v
IIe-10	H	H	C₃H_{7-i}	(2) OCH₃ (5) CH₃	-
IIe-11	H	H		(2) OCH₃ (5) CH₃	-
IIe-12	H	CH₃	CH₃	(2) OCH₃ (5) CH₃	-

[0347] 最优选的改进作物植物相容性的化合物〔组分 (b')〕为解草酯、解草唑、双苯噁唑酸、吡唑解草酯、解草恶唑、解草啉、苄草隆、杀草隆、哌草丹和化合物 IIe-5 与 IIe-11, 并且特别强调解草酯和吡唑解草酯。

[0348] 用作本发明安全剂的通式 (IIa) 的化合物为已知的并且 / 或者可通过本身已知的方法制备 (参见 WO-A-91/07874、WO-A-95/07897)。

[0349] 用作本发明安全剂的通式 (IIb) 的化合物为已知的并且 / 或者可通过本身已知的方法制备 (参见 EP-A-191736)。

[0350] 用作本发明安全剂的通式 (IIc) 的化合物为已知的并且 / 或者可通过本身已知的方法制备 (参见 DE-A-2218097、DE-A-2350547)。

[0351] 用作本发明安全剂的通式 (IId) 的化合物为已知的并且 / 或者可通过本身已知的方法制备 (参见 DE-A-19621522/US-A-6235680)。

[0352] 用作本发明安全剂的通式 (IIe) 的化合物为已知的并且 / 或者可通过本身已知的方法制备 (参见 WO-A-99/66795/US-A-6251827)。

[0353] 本发明的各自含有一种式 (I) 活性化合物并且各自含有一种上文定义的安全剂的选择性除草剂结合物的实例列于下表中。

[0354] 表本发明结合物的实例

[0355]

式 (I) 的活性化合物	安全剂
I-1-a	解草酯
I-1-a	解草唑
I-1-a	双苯噁唑酸
I-1-a	吡唑解草酯
I-1-a	解草恶唑

[0356]

式 (I) 的活性化合物	安全剂
I-1-a	解草啶
I-1-a	苄草隆
I-1-a	杀草隆
I-1-a	哌草丹
I-1-a	IIe-11
I-1-a	IIe-5
I-1-b	解草酯
I-1-b	解草唑
I-1-b	双苯噁唑酸
I-1-b	吡唑解草酯
I-1-b	解草恶唑
I-1-b	解草啶
I-1-b	苄草隆
I-1-b	杀草隆
I-1-b	哌草丹
I-1-b	IIe-11
I-1-b	IIe-5
I-1-c	解草酯
I-1-c	解草唑
I-1-c	双苯噁唑酸
I-1-c	吡唑解草酯
I-1-c	解草恶唑

I-1-c	解草啉
I-1-c	苄草隆
I-1-c	杀草隆
I-1-c	哌草丹
I-1-c	IIe-5
I-1-c	IIe-11
I-1-d	解草酯
I-1-d	解草唑
I-1-d	双苯噁唑酸
I-1-d	吡唑解草酯
I-1-d	解草恶唑
I-1-d	解草啉
I-1-d	苄草隆
I-1-d	杀草隆
I-1-d	哌草丹
I-1-d	IIe-11

[0357]

式 (I) 的活性化合物	安全剂
I-1-d	IIe-5
I-1-e	解草酯
I-1-e	解草唑
I-1-e	双苯噁唑酸
I-1-e	吡唑解草酯
I-1-e	解草恶唑

I-1-e	解草啉
I-1-e	苜草隆
I-1-e	杀草隆
I-1-e	派草丹
I-1-e	IIe-5
I-1-e	IIe-11
I-1-f	解草酯
I-1-f	解草唑
I-1-f	双苯噁唑酸
I-1-f	吡唑解草酯
I-1-f	解草恶唑
I-1-f	解草啉
I-1-f	苜草隆
I-1-f	杀草隆
I-1-f	派草丹
I-1-f	IIe-5
I-1-f	IIe-11
I-1-g	解草酯
I-1-g	解草唑
I-1-g	双苯噁唑酸
I-1-g	吡唑解草酯
I-1-g	解草恶唑
I-1-g	解草啉
I-1-g	苜草隆

I-1-g	杀草隆
I-1-g	哌草丹
I-1-g	IIe-5
I-1-g	IIe-11
I-2-a	解草酯
I-2-a	解草唑
I-2-a	双苯噁唑酸

[0358]

式 (I) 的活性化合物	安全剂
I-2-a	吡唑解草酯
I-2-a	解草恶唑
I-2-a	解草啶
I-2-a	苄草隆
I-2-a	杀草隆
I-2-a	哌草丹
I-2-a	IIe-5
I-2-a	IIe-11
I-2-b	解草酯
I-2-b	解草唑
I-2-b	双苯噁唑酸
I-2-b	吡唑解草酯
I-2-b	解草恶唑
I-2-b	解草啶
I-2-b	苄草隆

I-2-b	杀草隆
I-2-b	哌草丹
I-2-b	IIe-5
I-2-b	IIe-11
I-2-c	解草酯
I-2-c	解草唑
I-2-c	双苯噁唑酸
I-2-c	吡唑解草酯
I-2-c	解草恶唑
I-2-c	解草啶
I-2-c	苄草隆
I-2-c	杀草隆
I-2-c	哌草丹
I-2-c	IIe-5
I-2-c	IIe-11
I-2-d	解草酯
I-2-d	解草唑
I-2-d	双苯噁唑酸
I-2-d	吡唑解草酯
I-2-d	解草恶唑
I-2-d	解草啶
I-2-d	苄草隆

[0359]

式 (I) 的活性化合物	安全剂
--------------	-----

I-2-d	杀草隆
I-2-d	哌草丹
I-2-d	IIe-5
I-2-d	IIe-11
I-2-e	解草酯
I-2-e	解草唑
I-2-e	双苯噁唑酸
I-2-e	吡唑解草酯
I-2-e	解草恶唑
I-2-e	解草啶
I-2-e	苄草隆
I-2-e	杀草隆
I-2-e	哌草丹
I-2-e	IIe-5
I-2-e	IIe-11
I-2-f	解草酯
I-2-f	解草唑
I-2-f	双苯噁唑酸
I-2-f	吡唑解草酯
I-2-f	解草恶唑
I-2-f	解草啶
I-2-f	苄草隆
I-2-f	杀草隆
I-2-f	哌草丹

I-2-f	IIe-5
I-2-f	IIe-11
I-2-g	解草酯
I-2-g	解草唑
I-2-g	双苯噁唑酸
I-2-g	吡唑解草酯
I-2-g	解草恶唑
I-2-g	解草啉
I-2-g	苄草隆
I-2-g	杀草隆
I-2-g	哌草丹
I-2-g	IIe-5
I-2-g	IIe-11

[0360] 出人意料地,现已发现上文定义的通式(I)的化合物和以上所列组(b')中的安全剂(解毒剂)的活性化合物结合物兼具极好的有益植物耐受性和特别高的除草活性,并且可用于多种作物中——特别是谷类(尤其是小麦)中——以及大豆、马铃薯、玉米和稻中来选择性防治杂草。

[0361] 本文中,被认为出人意料的是,在许多能够对抗除草剂对作物植物的损害作用的已知安全剂或解毒剂中,其尤其是以上所列组(b')的化合物,所述化合物适于抵消——几乎完全地抵消——氧杂螺环型螺取代的特特拉姆酸和特窗酸衍生物对作物植物的损害作用,而同时对针对杂草的除草活性没有任何决定性的不利影响。

[0362] 本文中可强调的是选自组(b')的特别优选与最优选的结合组分的特别有利的效果,特别是对谷类植物的温和处理,所述谷类植物例如小麦、大麦和黑麦以及玉米和稻等作物植物。

[0363] 文献中已描述了可如何通过添加铵盐来提高各种活性化合物的活性。但是,所述盐为具有清洁作用的盐(例如W0 95/017817),或具有相对较长的烷基取代基和/或芳基取代基并具有渗透作用或增加活性化合物溶解度的盐(例如EP-A 0453086、EP-A 0664081、FR-A 2600494、US 4844734、US 5462912、US 5538937、US-A 03/0224939、US-A05/0009880、US-A 05/0096386)。此外,现有技术仅描述了针对特定活性化合物的活性和/或相应组合物的特定应用。在其他情形中,相反,所述盐为磺酸的盐,其中该酸部分对昆虫具有麻痹作用(US 2 842 476)。例如,描述了通过硫酸铵来提高例如除草剂草甘膦(glyphosate)和草

丁膦 (phosphinothricin) 及苯基取代的环状酮 - 烯醇类的活性 (US 6 645 914、EP-A2 0 036 106、WO 07/068427)。对杀虫剂活性的相应提高在 WO 07/068428 中有描述。

[0364] 还描述了硫酸铵作为配制助剂用于某些活性化合物及应用的用途 (WO 92/16108), 但是其中使用它的目的是为了稳定制剂, 而不是为了提高活性。

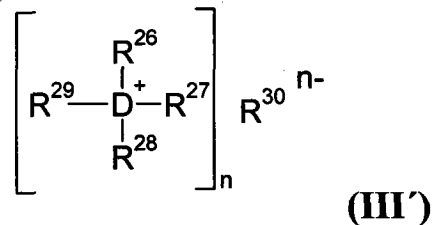
[0365] 完全出人意料地, 现已发现, 选自氧杂螺环型螺取代的特特拉姆酸和特窗酸衍生物的杀虫剂和 / 或杀螨剂和 / 或除草剂的活性可通过向施用溶液中添加铵盐或磷盐、或通过这些盐掺入含有氧杂螺环型螺取代的特特拉姆酸和特窗酸衍生物的制剂中而显著提高。因此, 本发明提供了铵盐或磷盐用于提高含有具有除草和 / 或杀虫和 / 或杀螨作用的氧杂螺环型螺取代的特特拉姆酸和特窗酸衍生物类作为其活性化合物的作物保护组合物的活性的用途。本发明还提供了含有除草和 / 或杀螨和 / 或杀虫作用的氧杂螺环型螺取代的特特拉姆酸和特窗酸衍生物以及提高活性的铵盐或磷盐的组合物, 该组合物不仅包括制剂型 (formulated) 活性化合物, 还包括即用型组合物 (喷雾液剂)。最后, 本发明还提供了所述组合物用于防治昆虫有害物和 / 或蛛螨和 / 或不需要植物生长的用途。

[0366] 式 (I) 化合物具有较宽的杀虫和 / 或杀螨和 / 或除草活性; 但是, 个别地, 活性和 / 或植物耐受性仍有待改进。

[0367] 活性化合物可以较宽的浓度范围用于本发明组合物中。制剂中活性化合物的浓度通常为 0.1-50 重量%。

[0368] 本发明提高含有脂肪酸生物合成抑制剂的作物保护组合物活性的铵盐和磷盐通过式 (III') 进行定义

[0369]



[0370] 其中

[0371] D 代表氮或磷,

[0372] D 优选代表氮,

[0373] R^{26} 、 R^{27} 、 R^{28} 和 R^{29} 相互独立地代表氢; 或各自任选被取代的 C_1 - C_8 烷基或者单不饱和或多不饱和的任选被取代的 C_1 - C_8 烯基, 所述取代基可选自卤素、硝基和氰基,

[0374] R^{26} 、 R^{27} 、 R^{28} 和 R^{29} 相互独立地优选代表氢, 或者各自任选被取代的 C_1 - C_4 烷基, 所述取代基可选自卤素、硝基和氰基,

[0375] R^{26} 、 R^{27} 、 R^{28} 和 R^{29} 相互独立地特别优选代表氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基,

[0376] R^{26} 、 R^{27} 、 R^{28} 和 R^{29} 极特别优选代表氢,

[0377] n 代表 1、2、3 或 4,

[0378] n 优选代表 1 或 2,

[0379] R^{30} 代表一种有机或无机阴离子,

[0380] R^{30} 优选代表碳酸氢根、四硼酸根、氟离子、溴离子、碘离子、氯离子、磷酸一氢根、磷

酸二氢根、硫酸氢根、酒石酸根、硫酸根、硝酸根、硫代硫酸根、硫氰酸根、甲酸根、乳酸根、乙酸根、丙酸根、丁酸根、戊酸根或草酸根，

[0381] R^{30} 特别优选代表乳酸根、硫酸根、硝酸根、硫代硫酸根、硫氰酸根、草酸根或甲酸根，

[0382] R^{30} 极特别优选代表硫酸根。

[0383] 本发明强调的活性化合物、盐和渗透剂的结合列于下表中。此处的“渗透剂按照试验”的含义为在表皮渗透试验 (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) 中起渗透剂作用的任意化合物均是适宜的。

[0384] 式 (III') 的铵盐和磷盐可在较宽的浓度范围内用于提高含有酮-烯醇类的作物保护组合物的活性。一般而言，铵盐或磷盐以 0.5-80mmol/l、优选 0.75-37.5mmol/l、更优选 1.5-25mmol/l 的浓度用于即用型作物保护组合中。对于制剂型产品，制剂中铵盐和 / 或磷盐浓度如此选择：在将该制剂稀释至所需的活性化合物浓度后，其值在所述宽泛的、优选的或特别优选的范围内。所述制剂中盐的浓度通常为 1-50 重量%。

[0385] 在本发明的一个优选实施方案中，通过向作物保护组合中不仅添加铵盐和 / 或磷盐而且还添加渗透剂来提高活性。被认为完全出人意料的是，甚至在所述情况下观察到甚至更大的活性的提高。因此本发明还提供了渗透剂和铵盐和 / 或磷盐的结合物用于提高含有具有杀虫作用的氧杂螺环型螺取代的特特拉姆酸和特窗酸衍生物类活性化合物的作物保护组合物的活性的用途。本发明还提供了含有具有除草和 / 或杀螨和 / 或杀虫作用的氧杂螺环型螺取代的特特拉姆酸和特窗酸衍生物、渗透剂及铵盐和 / 或磷盐的组合物，所述组合物具体而言不仅包括制剂型活性化合物而且包括即用型组合物（喷雾液剂）。最后，本发明还提供了所述组合物用于防治昆虫有害物的用途。

[0386] 本发明中适宜的渗透剂包括所有那些通常用于促进农业化学活性化合物渗入植物中的物质。在本文中渗透剂通过它们从含水喷雾液剂和 / 或从喷雾涂层渗入植物表皮并从而提高活性化合物在表皮中的移动性的能力进行定义。可使用文献中 (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) 所述方法来确定该特性。

[0387] 适宜的渗透剂的实例包括链烷醇烷氧基化物。本发明的渗透剂为式 (IV') 的链烷醇烷氧基化物

[0388] $R-O-(AO)_v-R'$ (IV')

[0389] 其中

[0390] R 为具有 4-20 个碳原子的直链或支链的烷基，

[0391] R' 为氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、正戊基或正己基，

[0392] AO 为亚乙基氧基团、亚丙基氧基团、亚丁基氧基团，或者为亚乙基氧基团和亚丙基氧基团或亚丁基氧基团的混合物，并且

[0393] v 为 2-30 中的一个数值。

[0394] 一类优选的渗透剂为下式的链烷醇烷氧基化物

[0395] $R-O-(EO)_n-R'$ (IV'-a)

[0396] 其中

[0397] R 定义如上，

[0398] R' 定义如上，

[0399] EO 为 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$, 并且

[0400] n 为 2-20 中的一个数值。

[0401] 另一类优选的渗透剂为下式的链烷醇烷氧基化物

[0402] $\text{R}-\text{O}-(-\text{EO}-)_p-(-\text{PO}-)_q-\text{R}'$ (IV' -b)

[0403] 其中

[0404] R 定义如上,

[0405] R' 定义如上,

[0406] EO 为 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$,

[0407] PO 为
$$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---O---} \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array},$$

[0408] p 为 1-10 中的一个数值, 并且

[0409] q 为 1-10 中的一个数值。

[0410] 另一类优选的渗透剂为下式的链烷醇烷氧基化物

[0411] $\text{R}-\text{O}-(-\text{PO}-)_r-(-\text{EO}-)_s-\text{R}'$ (IV' -c)

[0412] 其中

[0413] R 定义如上,

[0414] R' 定义如上,

[0415] EO 为 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$,

[0416] PO 为
$$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---O---} \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array},$$

[0417] r 为 1-10 中的一个数值, 并且

[0418] s 为 1-10 中的一个数值。

[0419] 另一类优选的渗透剂为下式的链烷醇烷氧基化物

[0420] $\text{R}-\text{O}-(-\text{EO}-)_p-(-\text{BO}-)_q-\text{R}'$ (IV' -d)

[0421] 其中

[0422] R 和 R' 定义如上,

[0423] EO 为 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$,

[0424] BO 为
$$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH---O---} \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array},$$

[0425] p 为 1-10 中的一个数值, 并且

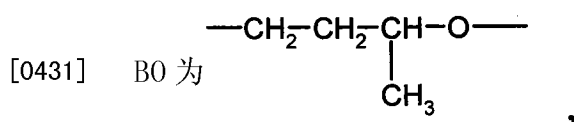
[0426] q 为 1-10 中的一个数值。

[0427] 另一类优选的渗透剂为下式的链烷醇烷氧基化物

[0428] $\text{R}-\text{O}-(-\text{BO}-)_r-(-\text{EO}-)_s-\text{R}'$ (IV' -e)

[0429] 其中

[0430] R 和 R' 定义如上,

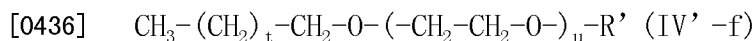


[0432] E0 为 $\text{CH}_2\text{---CH}_2\text{---O---}$,

[0433] r 为 1-10 中的一个数值, 并且

[0434] s 为 1-10 中的一个数值。

[0435] 另一类优选的渗透剂为下式的链烷醇烷氧基化物



[0437] 其中

[0438] R' 定义如上,

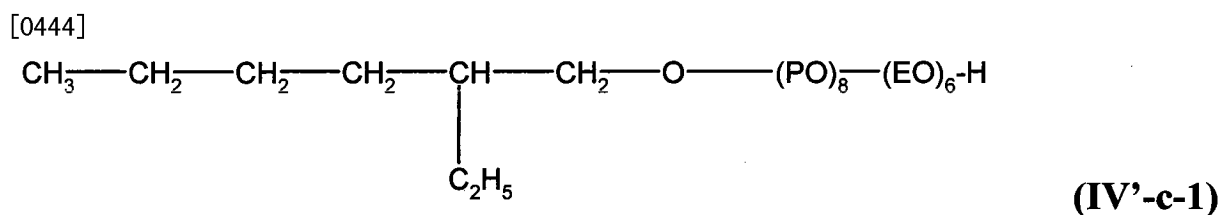
[0439] t 为 8-13 中的一个数值,

[0440] u 为 6-17 中的一个数值。

[0441] 在以上给出的式中,

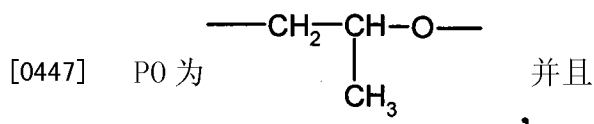
[0442] R 优选为丁基、异丁基、正戊基、异戊基、新戊基、正己基、异己基、正辛基、异辛基、2-乙基己基、壬基、异壬基、癸基、正十二烷基、异十二烷基、月桂基、肉豆蔻基、异十三烷基、三甲基壬基、棕榈基、硬脂基或二十烷基。

[0443] 可提及的式 (IV' -c) 的链烷醇烷氧基化物的一个实例为下式的 2-乙基己基烷氧基化物



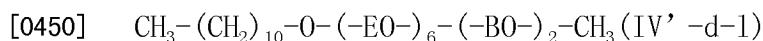
[0445] 其中

[0446] E0 为 $\text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---O---}$,



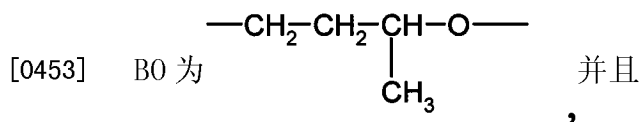
[0448] 数值 8 和 6 代表平均值。

[0449] 可提及的式 (IV' -d) 的链烷醇烷氧基化物的一个实例为下式



[0451] 其中

[0452] E0 为 $\text{CH}_2\text{---CH}_2\text{---O---}$,



[0454] 数值 10、6 和 2 代表平均值。

[0455] 特别优选的式 (IV' -f) 的链烷醇烷氧基化物为这样的化合物: 在该式中

[0456] t 为 9-12 中的一个数值, 并且

[0457] u 为 7-9 中的一个数值。

[0458] 可极特别优选提及式 (IV' -f-1) 的链烷醇烷氧基化物

[0459] $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_t-\text{CH}_2-\text{O}-(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O})_u-\text{H}(\text{IV}' -f-1)$

[0460] 其中

[0461] t 代表平均值 10.5, 并且

[0462] u 代表平均值 8.4。

[0463] 上式给出了链烷醇烷氧基化物的宽泛定义。这些物质为具有不同链长的所述类型化合物的混合物。因此其下标具有也可偏离整数的平均值。

[0464] 所述式的链烷醇烷氧基化物为已知的并且在一些情况下市售可得或可通过已知方法制备 (参见 WO 98/35553、WO 00/35278 和 EP-A0681865)。

[0465] 适宜的渗透剂还包括例如提高式 (I) 化合物在喷雾涂层中的利用率的物质。所述物质包括例如矿物油或植物油。适宜的油为通常可用于农业化学组合物中的改性的或未改性的所有矿物油或植物油。可提及的实例有向日葵油、油菜籽油 (rapeseed oil)、橄榄油、蓖麻油、菜籽油 (colza oil)、玉米籽油、棉籽油和豆油, 或所述油的酯类。优选油菜籽油、向日葵油及其甲基或乙基酯类。

[0466] 本发明组合物中渗透剂的浓度可在宽的范围内变化。对于制剂型作物保护组合物, 渗透剂的浓度通常为 1-95 重量%、优选 1-55 重量%、更优选 15-40 重量%。在即用型组合物 (喷雾液剂) 中, 所述浓度通常在 0.1 和 10g/l 之间、优选 0.5 和 5g/l 之间。

[0467] 本发明的作物保护组合物还可含有其他组分, 例如表面活性剂和 / 或分散助剂或乳化剂。

[0468] 适宜的非离子表面活性剂和 / 或分散助剂包括通常可用于农业化学组合物中的该类型的所有物质。可优选提及聚环氧乙烷-环氧丙烷嵌段共聚物、直链醇的聚乙二醇醚类、脂肪酸与环氧乙烷和 / 或环氧丙烷的反应产物, 以及聚乙烯醇、聚乙烯吡咯烷酮、聚乙烯醇与聚乙烯吡咯烷酮的共聚物, 及 (甲基) 丙烯酸与 (甲基) 丙烯酸酯的共聚物, 以及烷基乙氧基化物和烷基芳基乙氧基化物, 它们任选可被磷酸化并任选可用碱中和, 可提及的实例有山梨糖醇乙氧基化物, 以及聚氧亚烷基胺衍生物。

[0469] 适宜的阴离子表面活性剂为通常可用于农业化学组合物中的该类型的所有物质。优选烷基磺酸或烷基芳基磺酸的碱金属盐及碱土金属盐。

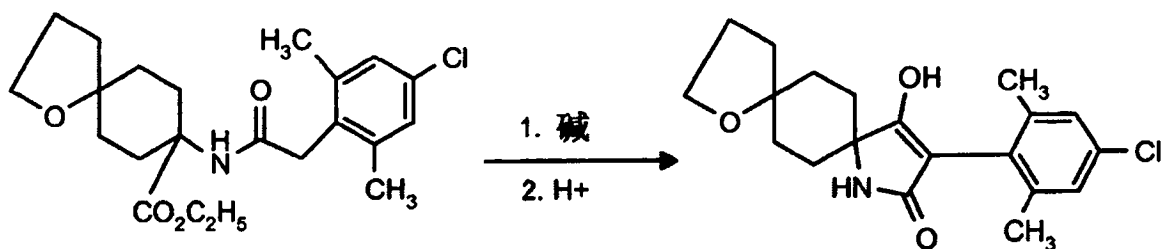
[0470] 另一优选组的阴离子表面活性剂和 / 或分散助剂为在植物油中具有低溶解度的以下盐: 聚苯乙烯磺酸的盐、聚乙烯磺酸的盐、萘磺酸-甲醛缩合产物的盐, 萘磺酸、酚磺酸及甲醛的缩合产物的盐, 以及木素磺酸的盐。

[0471] 本发明制剂中可含有的适宜添加剂有乳化剂、泡沫抑制剂、防腐剂、抗氧化剂、着色剂及惰性填充材料。

[0472] 优选的乳化剂有乙氧基化壬基酚、烷基酚与环氧乙烷和 / 或环氧丙烷的反应产物、乙氧基化芳基烷基酚, 以及乙氧基化和丙氧基化的芳基烷基酚, 以及硫酸化或磷酸化的芳基烷基乙氧基化物和 / 或芳基烷基乙氧基丙氧基化物, 可提及的实例有脱水山梨糖醇衍生物, 例如聚环氧乙烷-脱水山梨糖醇脂肪酸酯, 和脱水山梨糖醇脂肪酸酯。

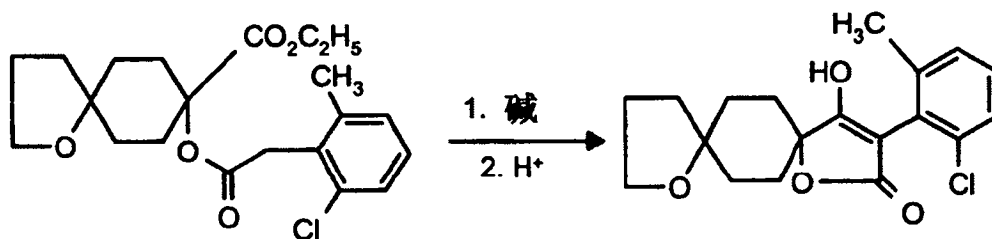
[0473] 例如, 根据方法 (A), 使用 N-[(4-氯-2,6-二甲基) 苯乙酰基]-1-氨基-4,4'-丙烯氧基环己烷羧酸乙酯作为原料, 本发明该方法的过程可通过以下反应方案表示:

[0474]



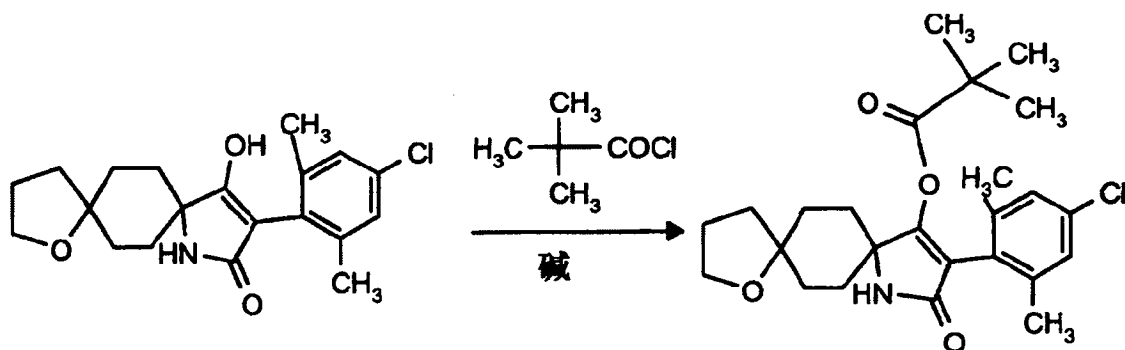
[0475] 例如,根据方法(B),使用0-[(2-氯-6-甲基)苯乙酰基]-1-羟基-4,4'-丙烯氧基环己烷羧酸乙酯作为原料,本发明该方法的过程可通过以下反应方案表示·

[0476]



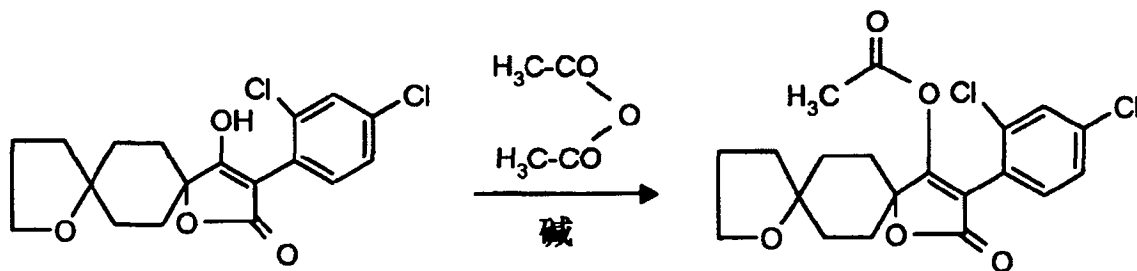
[0477] 例如,根据方法(C α),使用8,8'-丙烯氧基-3-[(4-氯-2,6-二甲基)苯基]-1-氮杂螺[4,5]癸烷-2,4-二酮和新戊酰氯作为原料,本发明该方法的过程可通过以下反应方案表示:

[0478]



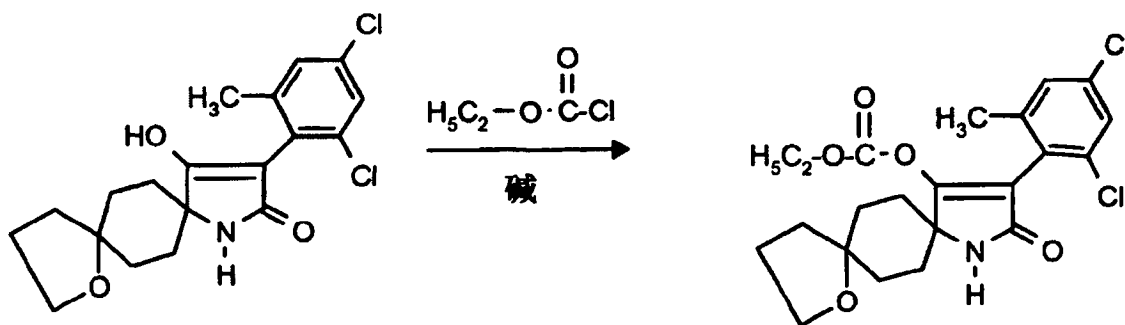
[0479] 例如,根据方法(C)(变型 β),使用8,8'-丙烯氧基-3-[(2,4-二氯)苯基]-1-氧杂螺-[4,5]-癸烷-2,4-二酮和乙酸酐作为原料,本发明该方法的过程可通过以下反应方案表示:

[0480]



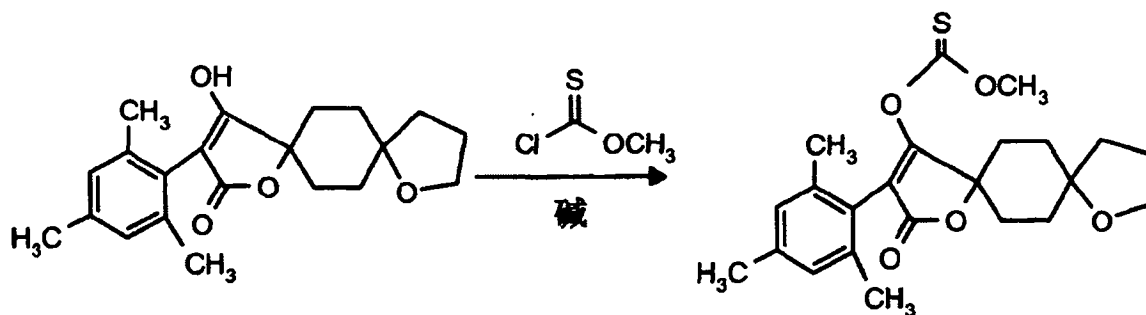
[0481] 例如,根据方法(D),使用8,8'-丙烯氧基-3-[(2,4-二氯-6-甲基)苯基]-1-氮杂螺[4,5]癸烷-2,4-二酮和氯甲酸乙酯作为原料,本发明该方法的过程可通过以下反应方案表示:

[0482]



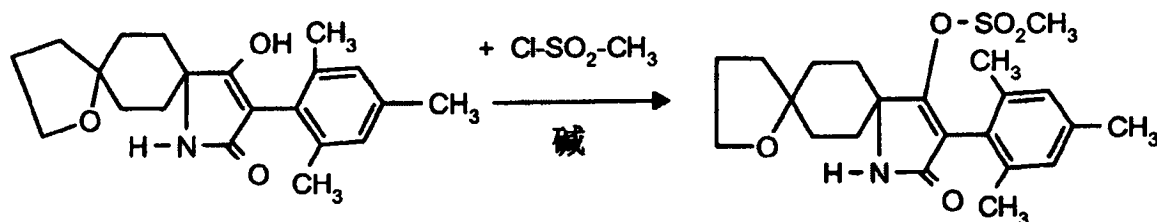
[0483] 例如,根据方法(E),使用8,8'-丙烯氧基-3-[(2,4,6-三甲基)苯基]-1-氧杂螺[4,5]癸烷-2,4-二酮和氯单硫代甲酸甲酯作为原料,本发明该方法的过程可通过以下反应方案表示:

[0484]



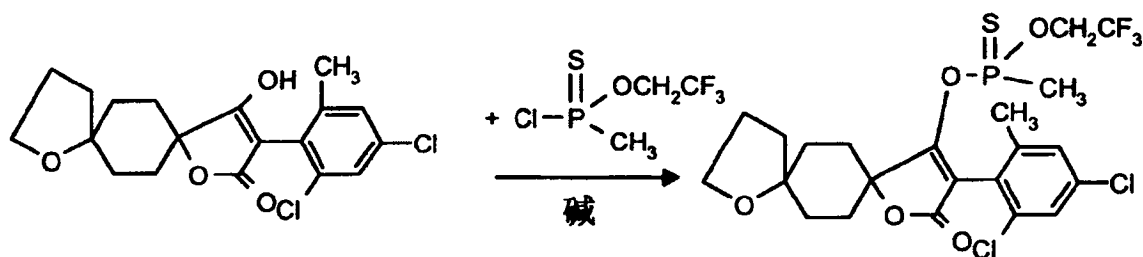
[0485] 例如,根据方法(F),使用8,8'-丙烯氧基-3-[(2,4,6-三甲基)苯基]-1-氮杂螺[4,5]癸烷-2,4-二酮和甲磺酰氯作为原料,本发明该方法的过程可通过以下反应方案表示:

[0486]



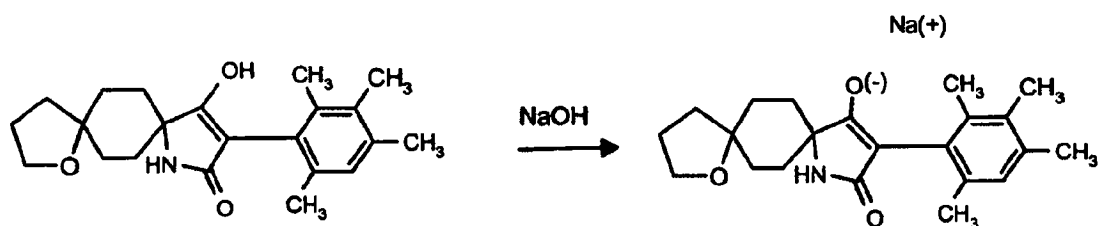
[0487] 例如,根据方法(G),使用8,8'-丙烯氧基-3-[(2,4-二氯-6-甲基)苯基]-1-氧杂螺[4,5]癸烷-2,4-二酮和2,2,2-三氟乙基甲硫代膦酰氯作为原料,该反应的过程可通过以下反应方案表示:

[0488]



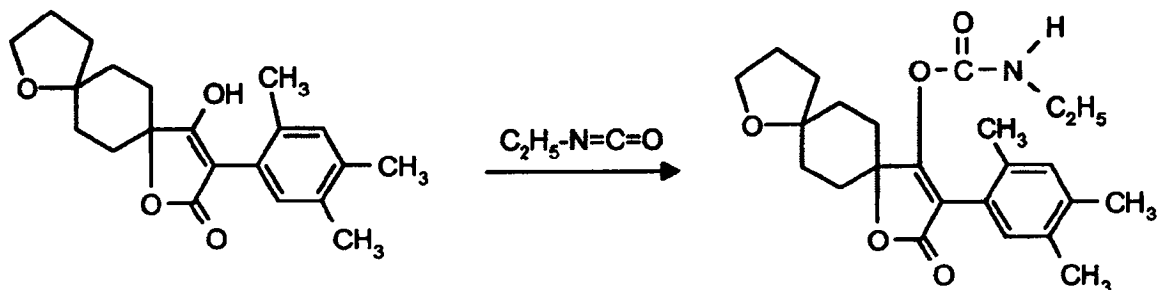
[0489] 例如,根据方法(H),使用8,8'-丙烯氧基-3-[(2,3,4,6-四甲基)苯基]-1-氮杂螺[4,5]癸烷-2,4-二酮和NaOH作为组分,本发明该方法的过程可通过以下反应方案表示:

[0490]



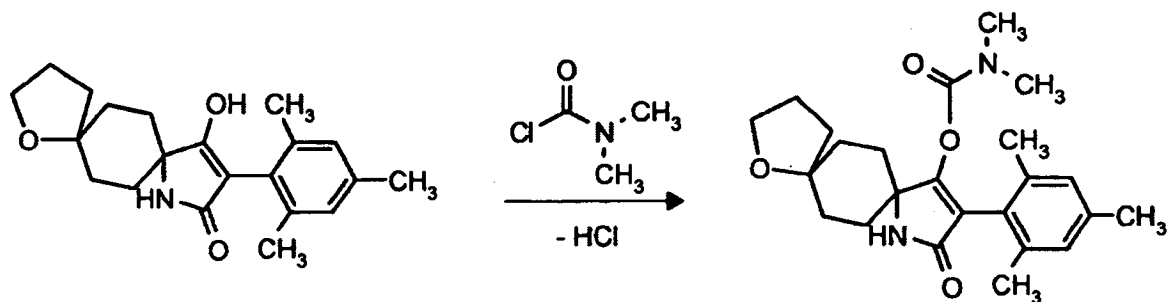
[0491] 例如,根据方法(I)(变型 α),使用8,8'-丙烯氧基-3-[(2,4,5-三甲基)苯基]-1-氧杂螺[4,5]癸烷-2,4-二酮和异氰酸乙酯作为原料,该反应的过程可通过以下反应方案表示:

[0492]



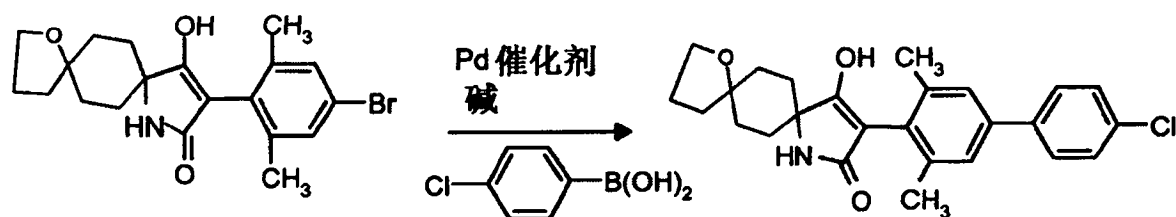
[0493] 例如,根据方法(I)(变型 β),使用8,8'-丙烯氧基-3-[(2,4,6-三甲基)苯基]-1-氮杂螺[4,5]癸烷-2,4-二酮和二甲基氨基甲酰氯作为原料,该反应的过程可通过以下方案表示:

[0494]



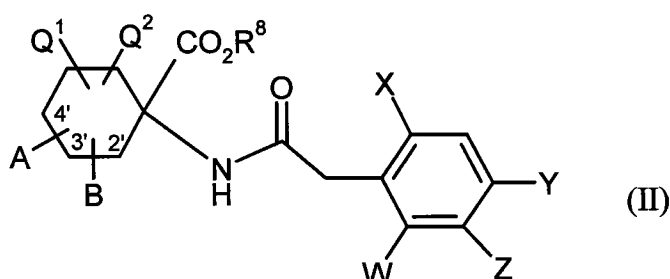
[0495] 例如, 根据方法 (J β), 使用 8,8'-丙烯氧基-3-[(4-溴-2,6-二甲基)苯基]-1-氮杂螺[4,5]癸烷-2,4-二酮和 4-氯苯基硼酸作为原料, 该反应的过程可通过以下反应方案表示:

[0496]



[0497] 作为本发明方法 (A) 中原料所需的式 (II) 化合物是新化合物,

[0498]

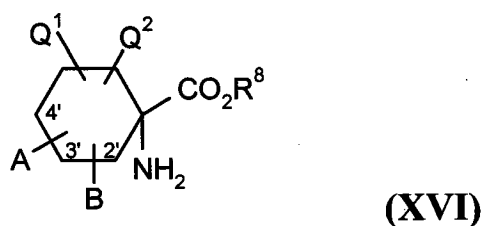


[0499] 其中

[0500] A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z 和 R⁸ 具有上文给出的含义。

[0501] 式 (II) 的酰基氨基酸酯, 当例如式 (XVI) 的氨基酸衍化物用式 (XVII) 的取代的苯基乙酸衍生物进行酰化时获得 (Chem. Reviews 52, 237-416 (1953); Bhattacharya, Indian J. Chem. 6, 341-5, 1968),

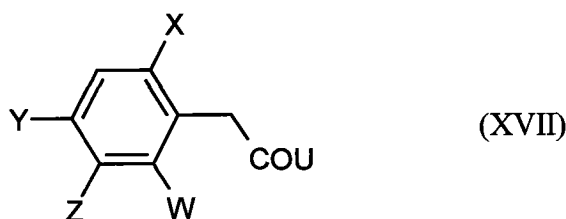
[0502]



[0503] 其中

[0504] A、B、Q¹ 和 Q² 及 R⁸ 具有上文给出的含义,

[0505]



[0506] 其中

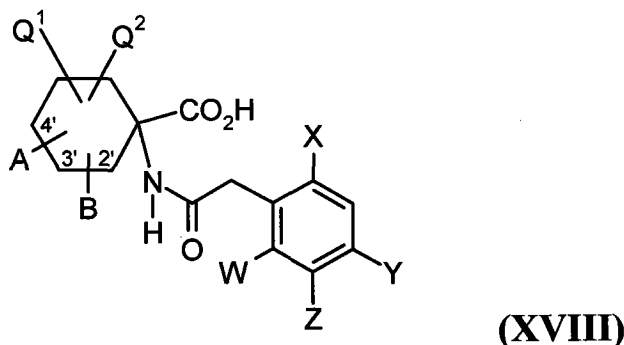
[0507] W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义, 并且

[0508] U 代表一个由用于活化羧酸的试剂引入的离去基团, 例如羰基二咪唑、碳二亚胺

(例如二环己基碳二亚胺)、磷酸化试剂(例如 POCl_3 、BOP-Cl)、卤化剂,例如亚硫酰氯、草酰氯、光气或氯甲酸酯;

[0509] 或当式 (XVIII) 的酰基氨基酸进行酯化时获得 (Chem. Ind. (London) 1568 (1968)),

[0510]

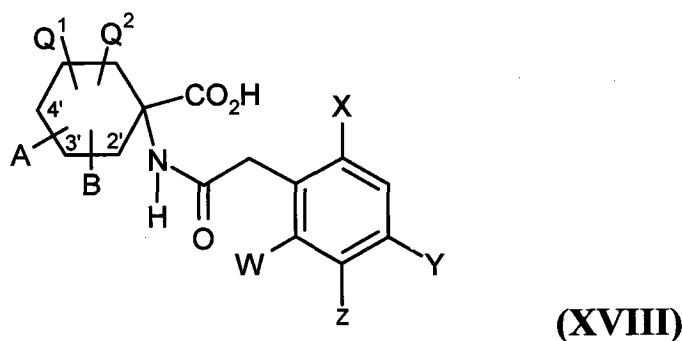


[0511] 其中

[0512] A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义。

[0513] 式 (XVIII) 的化合物为新化合物,

[0514]

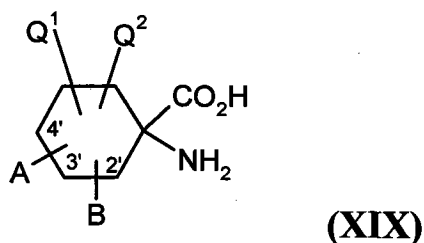


[0515] 其中

[0516] A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义。

[0517] 式 (XVIII) 的化合物,例如,根据 Schotten-Baumann (Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, 第 505 页),当例如式 (XIX) 的 1-氨基环己烷羧酸用式 (XVII) 的取代的苯基乙酸衍生物进行酰化时获得,

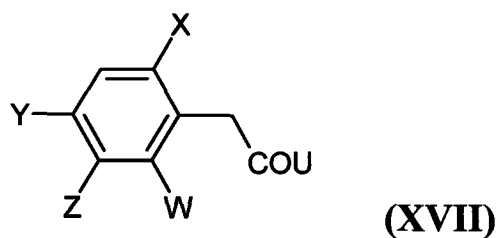
[0518]



[0519] 其中

[0520] A、B、 Q^1 和 Q^2 具有上文给出的含义,

[0521]



[0522] 其中

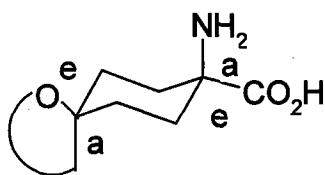
[0523] U、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义。

[0524] 式 (XVII) 化合物中的一些为已知的, 并且或者它们可通过开篇引用的公开出版物中的已知方法制备。

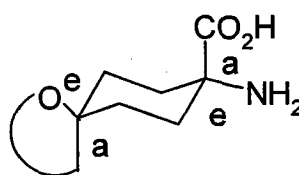
[0525] 式 (XVI) 和 (XIX) 的化合物为新化合物, 并且可通过已知方法制备 (参见, 例如 Compagnon, Ann. Chim. (Paris) [14]5, 第 11-22 页, 23-27 页 (1970), L. Munday, J. Chem. Soc. 4372 (1961); J. T. Eward, C. Jitrangeri, Can. J. Chem. 53, 3339 (1975))。

[0526] 所述新的 1-氨基-环己烷羧酸 (XIX) 通常可通过布赫尔-伯格合成法 (Bucherer Bergs synthesis) 或通过斯特雷克尔合成法 (Strecker synthesis) 获得, 其中它们以不同异构体形式得到。为简便起见, 下文中, 其中 4-位的氧原子和氨基在平伏/直立位置或直立/平伏位置的异构体称为 β 。为简便起见, 下文中, 其中氨基和 4-位的氧原子在平伏/平伏位置或直立/直立位置的异构体称为 α 。

[0527]



[0528] 实例: β 异构体

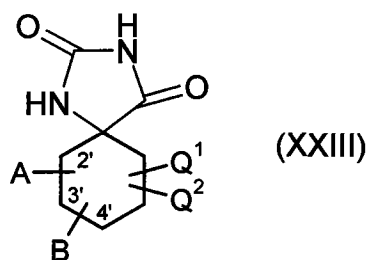


实例: α 异构体

[0529] (L. Munday, J. Chem. Soc. 4372 (1961))。

[0530] 式 (XIX) 的化合物可由式 (XXIII) 的化合物得到,

[0531]

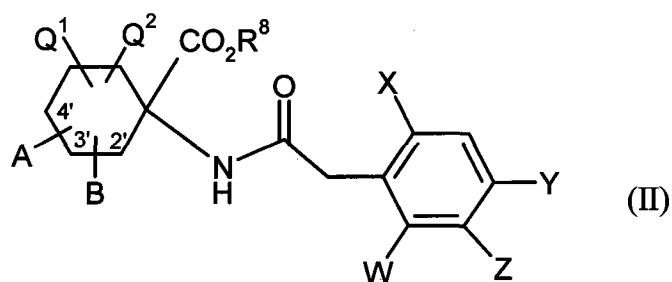


[0532] 其中 A、B、 Q^1 和 Q^2 具有上文给出的含义。

[0533] 式 (XXIII) 的化合物为新化合物, 并且可通过文献中已知的方法制备 (例如布赫尔-伯格反应, 另外参见实施例)。

[0534] 此外, 用于上述方法 (A) 中的式 (II) 的原料可通过以下方式制备: 使式 (XX) 的 1-氨基环己烷脒与式 (XVII) 的取代的苯基乙酸衍生物进行反应, 得到式 (XXI) 的化合物, 然后对其进行酸性醇解,

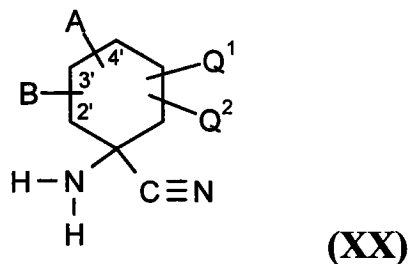
[0535]



[0536] 其中

[0537] A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z 和 R⁸ 具有上文给出的含义，

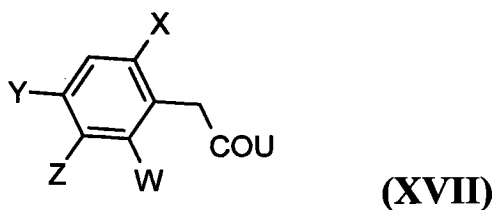
[0538]



[0539] 其中

[0540] A、B、Q¹ 和 Q² 具有上文给出的含义，

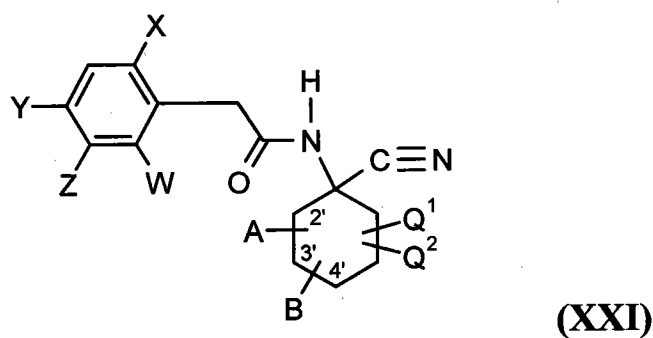
[0541]



[0542] 其中

[0543] U、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义

[0544]



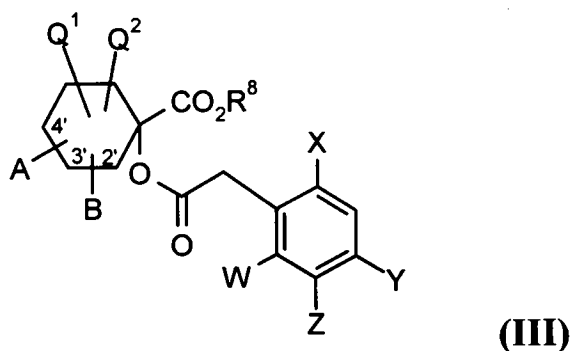
[0545] 其中

[0546] A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义。

[0547] 式 (XXI) 的化合物也是新化合物。式 (XX) 的化合物中的一些为新化合物，并且它们可按例如 EP-A-595130 中所述方法制备。

[0548] 作为本发明方法化合物 (B) 中原料所需的式 (III) 化合物是新化合物，

[0549]



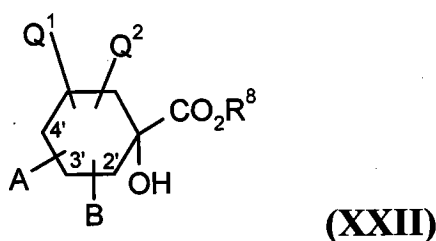
[0550] 其中

[0551] A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z 和 R⁸ 具有上文给出的含义。

[0552] 它们可通过原理上已知的方法以简单方式制备。

[0553] 式 (III) 的化合物,例如当式 (XXII) 的 1-羟基环己烷羧酸酯用式 (XVII) 的取代的苯基乙酸衍生物进行酰化时而得到,

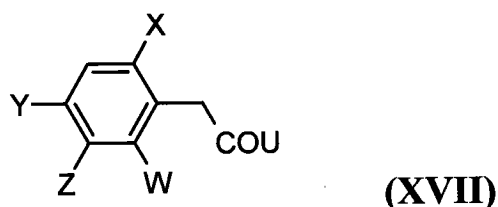
[0554]



[0555] 其中

[0556] A、B、Q¹、Q² 和 R⁸ 具有上文给出的含义,

[0557]



[0558] 其中

[0559] U、W、X、Y 和 Z 具有上文给出的含义

[0560] (Chem. Reviews 52, 237-416 (1953))。

[0561] 式 (XXII) 的 1-羟基-3-烷氧基环己基羧酸酯为新化合物。例如根据 Pinner 法,它们在取代的 1-羟基-4,4'-亚烷基氧基环己腈在酸的存在下与醇反应时得到。羟腈例如通过取代的 4,4'-亚烷基氧基环己-1-酮与氢氰酸反应而得到(参见 WO 99/16748)。

[0562] 作为实施本发明方法 (C)、(D)、(E)、(F)、(G)、(H)、(I) 和 (J) 所需的其他原料的式 (IV) 的酰基卤、式 (V) 的羧酸酐、式 (VI) 的氯甲酸酯或氯甲酸硫代酯、式 (VII) 的氯单硫代甲酸酯或氯二硫代甲酸酯、式 (VIII) 的磺酰氯、式 (IX) 的磷化合物和式 (X) 的金属氢氧化物、金属醇盐或式 (XI) 的胺,及式 (XII) 的异氰酸酯,及式 (XIII) 的氨基甲酰氯,以及式 (XV) 的硼酸,是通常已知的有机或无机化学的化合物。

[0563] 此外,式 (XVII)、(I-1-a') 至 (I-2-g') 和 (I-1-a'') 至 (I-2-g'') 的化合物还已知于开篇引用的专利申请,并且/或者它们可通过这些出版物中给出的方法制备。

[0564] 方法 (A) 的特征在于将式 (II) 的化合物——其中 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z 和 R⁸ 定义如上——在一种稀释剂的存在下并一种碱的存在下进行分子内缩合。

[0565] 适宜用作本发明方法 (A) 中的稀释剂的为所有对反应物呈惰性的有机溶剂。优选使用烃类,例如甲苯和二甲苯,以及醚类,例如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲醚和二乙二醇二甲醚,以及极性溶剂,例如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和 N-甲基吡咯烷酮,以及醇类,例如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

[0566] 用于实施本发明方法 (A) 的适宜碱类(脱质子剂)为所有常规质子受体。优选使用碱金属和碱土金属的氧化物、氢氧化物和碳酸盐,例如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙,它们也可在相转移催化剂的存在下使用,所述相转移催化剂例如,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)。此外也可使用碱金属,例如钠或钾。也可使用碱金属和碱土金属的氮化物和氢化物,例如氨基钠、氢化钠和氢化钙,以及碱金属的醇盐,例如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

[0567] 当实施本发明方法 (A) 时,反应温度可在相对较宽的范围内变化。一般而言,该方法在 -75℃ 和 200℃ 之间、优选 -50℃ 和 150℃ 之间的温度实施。本发明方法 (A) 通常在大气压下实施。

[0568] 当实施本发明方法 (A) 时,式 (II) 的反应组分和脱质子化碱通常以约双倍等摩尔量使用。但是,也可使用相对较大程度过量(最多至 3mol)的一种或另一种组分。

[0569] 方法 (B) 的特征在于式 (III) 的化合物——其中 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z 和 R⁸ 定义如上——在一种稀释剂的存在下并在一种碱的存在下进行分子内缩合。

[0570] 适宜用作本发明方法 (B) 中的稀释剂的为所有对反应物呈惰性的有机溶剂。优选使用烃类,例如甲苯和二甲苯,以及醚类,例如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲醚和二乙二醇二甲醚,以及极性溶剂,例如二甲基亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和 N-甲基吡咯烷酮。也可使用醇类,例如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

[0571] 用于实施本发明方法 (B) 的适宜碱类(脱质子剂)为所有常规质子受体。优选使用碱金属和碱土金属的氧化物、氢氧化物和碳酸盐,例如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙,它们也可在相转移催化剂的存在下使用,所述相转移催化剂例如,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)。也可使用碱金属,例如钠或钾。也可使用碱金属和碱土金属的氮化物和氢化物,例如氨基钠、氢化钠和氢化钙,以及碱金属的醇盐,例如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

[0572] 当实施本发明方法 (B) 时,反应温度可在相对较宽的范围内变化。一般而言,本方法在 -75℃ 和 200℃ 之间、优选 -50℃ 和 150℃ 之间的温度实施。

[0573] 本发明方法 (B) 通常在大气压力下实施。

[0574] 当实施本发明方法 (B) 时,式 (II) 的反应组分和脱质子化碱通常以约等摩尔量使用。但是,也可使用相对较大程度过量(最多至 3mol)的一种或另一种组分。

[0575] 方法 (C_a) 的特征在于式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物各自与式 (IV) 的碳酰卤反应,反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行。

[0576] 用于本发明方法 (C_a) 的适宜稀释剂为所有对酰基卤呈惰性的溶剂。优选使用烃

类,例如汽油、苯、甲苯、二甲苯和 1,2,3,4-四氢化萘;以及卤代烃类,例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、氯苯和邻-二氯苯;以及酮类,例如丙酮和甲基异丙基酮;以及醚类,例如乙醚、四氢呋喃和二噁烷;以及羧酸酯类,例如乙酸乙酯;以及强极性溶剂,例如二甲基甲酰胺、二甲亚砜和环丁砜。酰基卤的水解稳定性使得该反应也可在水的存在下进行。

[0577] 用于本发明方法(C_a)的反应的适宜酸结合剂为所有常规酸受体。优选使用叔胺,例如三乙胺、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,例如氧化镁和氧化钙;以及碱金属和碱土金属的碳酸盐,例如碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙;以及碱金属的氢氧化物,例如氢氧化钠和氢氧化钾。

[0578] 本发明方法(C_a)的反应温度可在相对较宽的范围内变化。一般而言,本方法在-20℃和+150℃之间、优选0℃和100℃之间的温度实施。

[0579] 当实施本发明方法(C_a)时,式(I-1-a)至(I-2-a)原料和式(IV)的碳酰卤通常各自以约相当的量使用。但是,也可使用相对较大程度过量(最多至5mol)的碳酰卤。通过常规方法实施后处理。

[0580] 方法(C_β)的特征在于式(I-1-a)至(I-2-a)的化合物各自与式(V)的羧酸酐反应,反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行。

[0581] 适宜在本发明方法(C_β)中用作稀释剂的为,优选那些在使用酰基卤时也优选的稀释剂。此外,过量的羧酸酐也可同时起到稀释剂的作用。

[0582] 方法(C_β)中——如果合适所添加的——适宜酸结合剂优选那些在使用酰基卤时也优选的酸结合剂。

[0583] 本发明方法(C_β)的反应温度可在相对较宽的范围内变化。一般而言,本方法在-20℃和+150℃之间、优选0℃和100℃之间的温度实施。

[0584] 当实施本发明方法(C_β)时,式(I-1-a)至(I-2-a)原料和式(V)的羧酸酐通常各自以约相当的量使用。但是,也可使用相对较大程度过量(最多至5mol)的羧酸酐。通过常规方法实施后处理。

[0585] 一般而言,稀释剂和过量的羧酸酐以及形成的羧酸通过蒸馏或者通过用一种有机溶剂或用水洗涤而除去。

[0586] 方法(D)的特征在于式(I-1-a)至(I-2-a)的化合物各自与式(VI)的氯甲酸酯或氯甲酸硫代酯反应,反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行。

[0587] 用于本发明方法(D)的反应的适宜酸结合剂为所有常规酸受体。优选使用叔胺,例如三乙胺、吡啶、DABCO、DBU、DBA、Hünig碱和N,N-二甲基苯胺;以及碱土金属的氧化物,例如氧化镁和氧化钙;以及碱金属和碱土金属的碳酸盐,例如碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙;以及碱金属的氢氧化物,例如氢氧化钠和氢氧化钾。

[0588] 在本发明方法(D)中使用的适宜稀释剂为所有对氯甲酸酯或氯甲酸硫代酯呈惰性的溶剂。优选使用烃类,例如汽油、苯、甲苯、二甲苯和1,2,3,4-四氢化萘;以及卤代烃类,例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、氯苯和邻-二氯苯;以及酮类,例如丙酮和甲基异丙基酮;以及醚类,例如乙醚、四氢呋喃和二噁烷;以及羧酸酯类,乙酸乙酯;以及腈类,例如乙腈;以及强极性溶剂,例如二甲基甲酰胺、二甲亚砜和环丁砜。

[0589] 当实施本发明方法 (D) 时, 反应温度可在相对较宽的范围内变化。反应温度通常在 -20°C 和 $+100^{\circ}\text{C}$ 之间、优选在 0°C 和 50°C 之间。

[0590] 本发明方法 (D) 通常在大气压下实施。

[0591] 当实施本发明方法 (D) 时, 式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的原料和式 (VI) 的适宜的氯甲酸酯或氯甲酸硫代酯通常各自以约相当的量使用。但是, 也可使用相对较大程度过量 (最多至 2mol) 的一种组分或另一种组分。通过常规方法实施后处理。通常地, 除去沉淀的盐, 并将剩余的反应混合物通过减压除去稀释剂进行浓缩。

[0592] 本发明方法 (E) 的特征在于式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物各自与式 (VII) 的化合物在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行反应。

[0593] 在制备方法 (E) 中, 每摩尔式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的原料在 $0-120^{\circ}\text{C}$ 、优选 $20-60^{\circ}\text{C}$ 下与约 1mol 式 (VII) 的氯单硫代甲酸酯或氯二硫代甲酸酯反应。

[0594] 如果合适所添加的适宜稀释剂为所有惰性极性有机溶剂, 例如醚、酰胺、砜、亚砜以及卤代烷。

[0595] 优选使用二甲亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺、乙酸乙酯或二氯甲烷。

[0596] 在一个优选的实施方案中, 如果化合物 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的烯醇式盐通过添加强脱质子剂例如氢化钠或叔丁醇钾进行制备, 则可免除另外添加酸结合剂。

[0597] 适于在方法 (E) 中使用的碱为所有常规质子受体。优选使用碱金属氢化物、碱金属的醇盐、碱金属或碱土金属的碳酸盐或碳酸氢盐或氮碱。可提及的有例如, 氢化钠、甲醇钠、氢氧化钠、氢氧化钙、碳酸钾、碳酸氢钠、三乙胺、二苄胺、二异丙胺、吡啶、喹啉、二氮杂双环辛烷 (DABCO)、二氮杂双环壬烯 (DBN) 和二氮杂双环十一碳烯 (DBU)。

[0598] 该反应可在大气压或较高的压力下实施, 并且优选在大气压下实施。通过常规方法进行后处理。

[0599] 本发明方法 (F) 的特征在于, 式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物各自与式 (VIII) 的磺酰氯反应, 反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行。

[0600] 在制备方法 (F) 中, 每摩尔式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的原料与约 1mol 式 (VIII) 的磺酰氯在 $-20-150^{\circ}\text{C}$ 、优选 $0-70^{\circ}\text{C}$ 下反应。

[0601] 方法 (F) 优选在一种稀释剂的存在下实施。

[0602] 适宜稀释剂为所有惰性的极性有机溶剂, 例如醚、酰胺、酮、羧酸酯、腈、砜、亚砜, 或卤代烃类, 例如二氯甲烷。

[0603] 优选使用二甲亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺、乙酸乙酯、二氯甲烷。

[0604] 在一个优选的实施方案中, 如果 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物中的烯醇式盐通过添加强脱质子剂 (例如氢化钠或叔丁醇钾) 进行制备, 则可免去另外添加酸结合剂。

[0605] 如果使用酸结合剂, 则常规无机或有机碱是适宜的, 例如氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、吡啶、三乙胺。

[0606] 该反应可在大气压或较高的压力下实施, 并且优选在大气压下实施。通过常规方法进行后处理。

[0607] 本发明方法 (G) 的特征在于式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物各自与式 (IX) 的磷化合物反应, 反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下

进行。

[0608] 在制备方法 (G) 中,为得到式 (I-1-e) 至 (I-2-e) 的化合物,在 -40°C 和 150°C 之间、优选 -10 和 110°C 之间的温度,每摩尔 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物使用 1-2mol、优选 1-1.3mol 式 (XX) 的磷化合物。

[0609] 方法 (G) 优选在一种稀释剂的存在下实施。

[0610] 适宜稀释剂为所有惰性的极性有机溶剂,例如醚、羧酸酯、卤代烃、酮、酰胺、腈、砜、亚砜等。

[0611] 优选使用乙腈、二甲亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺、二氯甲烷。

[0612] 如果合适添加的适宜酸结合剂为常规无机或有机碱,例如氢氧化物、碳酸盐或胺。可作为实例提及的有氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、吡啶、三乙胺。

[0613] 该反应可在大气压下或提高的压力下实施,并且优选在大气压下实施。通过有机化学中的常规方法进行后处理。得到的终产物优选通过结晶、色谱法纯化或通过所称的“减压蒸馏 (incipient distillation)”——即减压下除去挥发性组分——进行纯化。

[0614] 方法 (H) 的特征在于式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物各自与式 (X) 的金属氢氧化物或金属醇盐或者式 (XI) 的胺进行反应,反应如果合适在一种稀释剂的存在下进行。

[0615] 适宜用作本发明方法 (H) 的稀释剂的为,优选醚,例如四氢呋喃、二噁烷、乙醚;以及醇类,例如甲醇、乙醇、异丙醇;以及水。本发明方法 (H) 通常在大气压下实施。反应温度通常在 -20°C 和 100°C 之间、优选在 0°C 和 50°C 之间。

[0616] 本发明方法 (I) 的特征在于,式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物各自与 (I- α) 式 (XII) 的化合物反应,反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种催化剂的存在下进行;或者与 (I- β) 式 (XIII) 的化合物反应,如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行。

[0617] 在制备方法 (I- α) 中,在 0 至 100°C 、优选 20 至 50°C ,每摩尔式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的原料使用约 1mol 式 (XII) 的异氰酸酯。

[0618] 方法 (I- α) 优选在一种稀释剂的存在下实施。

[0619] 适宜稀释剂为所有惰性有机溶剂,例如芳烃、卤代烃、醚、酰胺、腈、砜或亚砜。

[0620] 如果合适,可添加催化剂以加速该反应。适宜使用的催化剂,极有利地为有机锡化合物,例如二月桂酸二丁锡。

[0621] 该反应优选在大气压下实施。

[0622] 在制备方法 (I- β) 中,在 0 至 150°C 、优选 20°C 至 70°C ,每摩尔式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的原料使用约 1mol 式 (XIII) 的氨基甲酰氯。

[0623] 如果合适所添加的适宜稀释剂为所有惰性的极性有机溶剂,例如醚、羧酸酯、腈、酮、酰胺、砜、亚砜或卤代烃。

[0624] 优选使用二甲亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺或二氯甲烷。

[0625] 在一个优选的实施方案中,如果化合物 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的烯醇式盐通过添加强脱质子剂(例如氢化钠或叔丁醇钾)进行制备,则可免去另外添加酸结合剂。

[0626] 如果使用酸结合剂,则常规无机或有机碱是适宜的,所述碱的实例有氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、三乙胺或吡啶。

[0627] 该反应可在大气压或较高的压力下实施,并且优选在大气压下实施。通过常规方

法进行后处理。

[0628] 实施本发明方法(J α)和(J β)的适宜催化剂为钯(0)复合物。优选例如四(三苯基膦)钯。如果合适,也可使用钯(II)化合物,例如PdCl₂、Pd(OAc)₂。如果使用钯(II)化合物,则通常使用膦类——例如三环己基膦——作为复合物形成体。

[0629] 用于实施本发明方法(J α)和(J β)的适宜的酸受体为无机或有机碱。它们优选包括碱土金属或碱金属氢氧化物、乙酸盐、碳酸盐或碳酸氢盐,例如氢氧化钠、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、碳酸铯或碳酸铵、碳酸氢钠或碳酸氢钾;碱金属氟化物,例如氟化铯;碱金属磷酸盐,例如磷酸二氢钾、磷酸钾;以及叔胺,例如三甲胺、三乙胺、三丁胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基苄胺、吡啶、N-甲基哌啶、N-甲基吗啉、N,N-二甲基氨基吡啶、二氮杂双环辛烷(DABCO)、二氮杂双环壬烯(DBN)或二氮杂双环十一碳烯(DBU)。

[0630] 实施本发明方法(J α)和(J β)的适宜稀释剂为水、有机溶剂及其任意混合物。可提及以下实例:脂族、脂环族或芳香族的烃类,例如石油醚、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,例如氯苯、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,例如乙醚、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、二乙二醇二甲醚或苯甲醚;醇类,例如甲醇、乙醇、正丙醇或异丙醇、正丁醇、异丁醇、仲丁醇或叔丁醇、乙二醇、丙-1,2-二醇、乙氧基乙醇、甲氧基乙醇、二乙二醇一甲基醚;水。

[0631] 在本发明方法(J α)和(J β)中,反应温度可在相对较宽的范围内变化。一般而言,该方法在0°C和+140°C之间、优选50°C和+100°C之间的温度实施。

[0632] 当实施本发明方法(J α)和(J β)时,式(XV α)和(XV β)的硼酸——其中Y和Z具有上文给出的含义,和式(I-1-a')至(I-2-g')的化合物——其中A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X、Y和Z'具有上文给出的含义——或式(I-1-a'')至(I-2-g'')的化合物——其中A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X、Z和Y'具有上文给出的含义,以1:1至3:1、优选1:1至2:1的摩尔比使用。一般地,每摩尔式(I-1-a')至(I-2-g')或(I-1-a'')至(I-2-g'')的化合物使用0.005至0.5mol、优选0.01mol至0.1mol催化剂。通常使用过量的所述碱。通过常规方法进行后处理。

[0633] 本发明的活性化合物,兼具良好的植物耐受性和对温血动物有利的毒性以及良好的环境耐受性,适于保护植物和植物器官、提高采收产率、改善采收物的品质和用于防治动物有害物,特别是在农业、园艺、畜牧业、森林、园林和休闲设施、贮存产品和材料的保护及卫生领域中遇到的昆虫、蛛形纲动物、蠕虫、线虫和软体动物。它们可优选用作作物保护剂。它们对通常敏感的和抗性物种及对所有或一些发育阶段均有活性。上述害虫包括:

[0634] 虱目(Anoplura, Phthiraptera),例如,畜虱属(Damalinia spp.)、血虱属(Haematopinus spp.)、毛虱属(Linognathus spp.)、虱属(Pediculus spp.)、嚼虱属(Trichodectes spp.)。

[0635] 蛛形纲(Arachnida),例如,粗脚粉螨(Acarus siro)、柑橘瘤瘿螨(Aceria sheldoni)、刺皮瘿螨属(Aculops spp.)、针刺瘿螨属(Aculus spp.)、花蜱属(Amblyomma spp.)、锐缘蜱属(Argas spp.)、牛蜱属(Boophilus spp.)、短须螨属(Brevipalpus spp.)、苜蓿苔螨(Bryobia praetiosa)、皮螨属(Chorioptes spp.)、鸡皮刺螨(Dermanyssus

gallinae)、始叶螨属 (*Eotetranychus* spp.)、梨上癭螨 (*Epitrimerus pyri*)、真叶螨属 (*Eutetranychus* spp.)、癭螨属 (*Eriophyes* spp.)、半跗线螨属 (*Hemitarsonemus* spp.)、璃眼蜱属 (*Hyalomma* spp.)、硬蜱属 (*Ixodes* spp.)、黑寡妇蜘蛛 (*Latrodectus mactans*)、*Metatetranychus* spp.、小爪螨属 (*Oligonychus* spp.)、钝缘蜱属 (*Ornithodoros* spp.)、全爪螨属 (*Panonychus* spp.)、桔芸锈螨 (*Phyllocoptruta oleivora*)、侧多食跗线螨 (*Polyphagotarsonemus latus*)、痒螨属 (*Psoroptes* spp.)、扇头蜱属 (*Rhipicephalus* spp.)、根螨属 (*Rhizoglyphus* spp.)、疥螨属 (*Sarcoptes* spp.)、中东金蝎 (*Scorpio maurus*)、*Stenotarsonemus* spp.、跗线螨属 (*Tarsonemus* spp.)、叶螨属 (*Tetranychus* spp.)、*Vasates lycopersici*。

[0636] Bivalva 纲,例如, *Dreissena* spp.。

[0637] 唇足目 (Chilopoda),例如,地蜈蚣属 (*Geophilus* spp.)、*Scutigera* spp.。

[0638] 鞘翅目 (Coleoptera),例如,菜豆象 (*Acanthoscelides obtectus*)、喙丽金龟属 (*Adoretus* spp.)、杨树萤叶甲 (*Agelastica alni*)、叩甲属 (*Agriotes* spp.)、马铃薯鳃角金龟 (*Amphimallon solstitialis*)、家具窃蠹 (*Anobium punctatum*)、星天牛属 (*Anoplophora* spp.)、花象属 (*Anthonomus* spp.)、圆皮蠹属 (*Anthrenus* spp.)、阿鳃金龟属 (*Apogonia* spp.)、*Atomaria* spp.、毛皮蠹属 (*Attagenus* spp.)、恶条豆象 (*Bruchidius obtectus*)、豆象属 (*Bruchus* spp.)、龟象属 (*Ceuthorhynchus* spp.)、*Cleonus mendicus*、宽胸叩头虫属 (*Conoderus* spp.)、根颈象属 (*Cosmopolites* spp.)、褐新西兰肋翅鳃角金龟 (*Costelytra zealandica*)、象虫属 (*Curculio* spp.)、杨干隐喙象 (*Cryptorhynchus lapathi*)、皮蠹属 (*Dermestes* spp.)、叶甲属 (*Diabrotica* spp.)、食植瓢虫属 (*Epilachna* spp.)、*Faustinus cubae*、裸蛛甲 (*Gibbium psylloides*)、黑异爪蔗金龟 (*Heteronychus arator*)、*Hylamorpha elegans*、北美家天牛 (*Hylotrupes bajulus*)、紫苜蓿叶象 (*Hypera postica*)、*Hypothenemus* spp.、甘蔗大褐齿爪鳃金龟 (*Lachnosterna consanguinea*)、马铃薯甲虫 (*Leptinotarsa decemlineata*)、稻根象 (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、筒喙象属 (*Lixus* spp.)、粉蠹属 (*Lyctus* spp.)、油菜花露尾甲 (*Meligethes aeneus*)、西方五月鳃角金龟 (*Melolontha melolontha*)、*Migdolus* spp.、墨天牛属 (*Monochamus* spp.)、*Naupactus xanthographus*、黄蛛甲 (*Niptus hololeucus*)、椰蛀犀金龟 (*Oryctes rhinoceros*)、锯谷盗 (*Oryzaephilus surinamensis*)、黑葡萄耳象 (*Otiorrhynchus sulcatus*)、小青花金龟 (*Oxycetonia jucunda*)、辣根猿叶虫 (*Phaedon cochleariae*)、食叶鳃金龟属 (*Phyllophaga* spp.)、日本弧丽金龟 (*Popillia japonica*)、*Premnotrypes* spp.、油菜金头跳甲 (*Psylliodes chrysocephala*)、蛛甲属 (*Ptinus* spp.)、暗色瓢虫 (*Rhizobius ventralis*)、谷蠹 (*Rhizopertha dominica*)、谷象属 (*Sitophilus* spp.)、尖隐喙象属 (*Sphenophorus* spp.)、茎干象属 (*Sternechus* spp.)、*Symphyletes* spp.、黄粉虫 (*Tenebrio molitor*)、拟谷盗属 (*Tribolium* spp.)、斑皮蠹属 (*Trogoderma* spp.)、籽象属 (*Tychius* spp.)、脊虎天牛属 (*Xylotrechus* spp.)、距步甲属 (*Zabrus* spp.)。

[0639] 弹尾目 (Collembola),例如,武装棘跳虫 (*Onychiurus armatus*)。

[0640] 革翅目 (Dermaptera),例如,欧洲球螋 (*Forficula auricularia*)。

[0641] 倍足目 (Diplopoda),例如, *Blaniulus guttulatus*。

[0642] 双翅目 (Diptera),例如,伊蚊属 (*Aedes* spp.)、按蚊属 (*Anopheles* spp.)、

花园毛蚊 (*Bibio hortulanus*)、红头丽蝇 (*Calliphora erythrocephala*)、地中海蜡实蝇 (*Ceratitis capitata*)、金蝇属 (*Chrysomyia* spp.)、锥蝇属 (*Cochliomyia* spp.)、*Cordylobia anthropophaga*、库蚊属 (*Culex* spp.)、黄蝇属 (*Cuterebra* spp.)、橄榄大实蝇 (*Dacus oleae*)、人肤蝇 (*Dermatobia hominis*)、果蝇属 (*Drosophila* spp.)、厕蝇属 (*Fannia* spp.)、胃蝇属 (*Gastrophilus* spp.)、黑蝇属 (*Hylemyia* spp.)、*Hyppobosca* spp.、皮蝇属 (*Hypoderma* spp.)、斑潜蝇属 (*Liriomyza* spp.)、绿蝇属 (*Lucilia* spp.)、家蝇属 (*Musca* spp.)、绿蝽属 (*Nezara* spp.)、狂蝇属 (*Oestrus* spp.)、瑞典麦秆蝇 (*Oscinella frit*)、藜泉蝇 (*Pegomyia hyoscyami*)、草种蝇属 (*Phorbiaspp.*)、螫蝇属 (*Stomoxys* spp.)、虻属 (*Tabanus* spp.)、*Tannia* spp.、欧洲大蚊 (*Tipula paludosa*)、污蝇属 (*Wohlfahrtia* spp.)。

[0643] 腹足纲 (*Gastropoda*)，例如，*Arion* spp.、双脐螺属 (*Biomphalaria*spp.)、小泡螺属 (*Bulinus* spp.)、*Deroceras* spp.、土蜗属 (*Galba* spp.)、椎实螺属 (*Lymnaea* spp.)、钉螺属 (*Oncomelania* spp.)、琥珀螺属 (*Succinea*spp.)。

[0644] 蠕虫纲 (*Helminths*)，例如，十二指肠钩口线虫 (*Ancylostomaduodenale*)、斯里兰卡钩口线虫 (*Ancylostoma ceylanicum*)、巴西钩口线虫 (*Acylostoma braziliensis*)、钩口线虫属 (*Ancylostoma* spp.)、似引蛔线虫 (*Ascaris lubricoides*)、蛔虫属 (*Ascaris* spp.)、马来布鲁线虫 (*Brugiamalayi*)、帝汶布鲁线虫 (*Brugia timori*)、仰口线虫属 (*Bunostomum* spp.)、夏柏特线虫属 (*Chabertia* spp.)、枝睾吸虫属 (*Clonorchis* spp.)、古柏线虫属 (*Cooperia* spp.)、双腔吸虫属 (*Dicrocoelium* spp.)、丝状网尾线虫 (*Dictyocaulus filaria*)、阔节裂头绦虫 (*Diphyllobothrium latum*)、麦地那龙线虫 (*Dracunculus medinensis*)、细粒棘球绦虫 (*Echinococcus granulosus*)、多房棘球绦虫 (*Echinococcus multilocularis*)、蠕形住肠蛲虫 (*Enterobius vermicularis*)、*Faciola* spp.、血毛线虫属 (*Haemonchus* spp.)、异刺线虫属 (*Heterakis* spp.)、矮小啮壳绦虫 (*Hymenolepis nana*)、猪圆线虫属 (*Hyostrogylus* spp.)、罗阿罗阿线虫 (*Loa Loa*)、细颈线虫属 (*Nematodirus* spp.)、结节线虫属 (*Oesophagostomum* spp.)、后睾吸虫属 (*Opisthorchis* spp.)、旋盘尾丝虫 (*Onchocerca volvulus*)、奥斯脱线虫属 (*Ostertagia* spp.)、并殖吸虫属 (*Paragonimus* spp.)、*Schistosomen* spp.、富氏类圆线虫 (*Strongyloides fuelleborni*)、粪类圆线虫 (*Strongyloidesstercoralis*)、粪圆线虫属 (*Strongyloides* spp.)、牛带绦虫 (*Taenia saginata*)、猪带绦虫 (*Taenia solium*)、旋毛形线虫 (*Trichinella spiralis*)、本地毛形线虫 (*Trichinella nativa*)、株布氏旋毛虫 (*Trichinella britovi*)、南方旋毛虫 (*Trichinella nelsoni*)、*Trichinella pseudopsiralis*、毛圆线虫属 (*Trichostrongylus* spp.)、*Trichuris trichuria*、班氏吴策线虫 (*Wuchereriabancrofti*)。

[0645] 还可防治原生动物，例如艾美虫 (*Eimeria*)。

[0646] 异翅目 (*Heteroptera*)，例如，南瓜缘蝽 (*Anasa tristis*)、拟丽蝽属 (*Antestiopsis* spp.)、土长蝽属 (*Blissus* spp.)、俊盲蝽属 (*Calocoris* spp.)、*Campylomma livida*、异背长蝽属 (*Cavelerius* spp.)、臭虫属 (*Cimex* spp.)、*Creontiades dilutus*、胡椒缘蝽 (*Dasynus piperis*)、*Dichelops furcatus*、厚氏长棒网蝽 (*Diconocoris hewetti*)、棉红蝽属 (*Dysdercus* spp.)、美洲蝽属 (*Euschistus*

spp.)、扁盾蝽属 (*Eurygaster* spp.)、*Heliopeltis* spp.、*Horciasnobilellus*、稻缘蝽属 (*Leptocoris*a spp.)、叶喙缘蝽 (*Leptoglossus* *phyllopus*)、草盲蝽属 (*Lygus* spp.)、蔗黑长蝽 (*Macropes excavatus*)、盲蝽科 (*Miridae*)、绿蝽属、*Oebalus* spp.、*Pentomidae*、方背皮蝽 (*Piesma* *quadrata*)、壁蝽属 (*Piezodorus* spp.)、棉伪斑腿盲蝽 (*Psallus seriatus*)、*Pseudacysta perseae*、红猎蝽属 (*Rhodnius* spp.)、可可褐盲蝽 (*Sahlbergellasingularis*)、黑蝽属 (*Scotinophora* spp.)、梨冠网蝽 (*Stephanitis nashi*)、*Tibraca* spp.、锥猎蝽属 (*Triatoma* spp.)。

[0647] 同翅目 (*Homoptera*)，例如，无网长管蚜属 (*Acyrtosipon* spp.)、*Aeneolamia* spp.、隆脉木虱属 (*Agonosce*na spp.)、*Aleurodes* spp.、蔗粉虱属 (*Aleurolobus barodensis*)、*Aleurothrixus* spp.、杧果叶蝉属 (*Amrascas* spp.)、*Anuraphis cardui*、肾圆盾蚧属 (*Aonidiella* spp.)、苏联黄粉蚜 (*Aphanostigma piri*)、蚜属 (*Aphis* spp.)、葡萄叶蝉 (*Arboridia apicalis*)、小圆盾蚧属 (*Aspidiella* spp.)、圆盾蚧属 (*Aspidiotus* spp.)、*Atanus* spp.、茄沟无网蚜 (*Aulacorthum solani*)、*Bemisia* spp.、李短尾蚜 (*Brachycaudus helichrysi*)、*Brachycolus* spp.、甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*)、小褐稻虱 (*Calligypona marginata*)、*Carneocephala fulgida*、甘蔗粉角蚜 (*Ceratovacuna lanigera*)、沫蝉科 (*Cercopidae*)、蜡蚧属 (*Ceroplastes* spp.)、草莓钉蚜 (*Chaetosiphon fragaefolii*)、蔗黄雪盾蚧 (*Chionaspis tegalensis*)、茶绿叶蝉 (*Chlorita onukii*)、核桃黑斑蚜 (*Chromaphis juglandicola*)、黑褐圆盾蚧 (*Chrysomphalus ficus*)、玉米叶蝉 (*Cicadulina mbila*)、*Cocco*mytilus *halli*、软蚧属 (*Coccus* spp.)、茶蔗隐瘤蚜 (*Cryptomyzus ribis*)、*Dalbulus* spp.、*Dialeurodes* spp.、*Diaphorina* spp.、白背盾蚧属 (*Diaspis* spp.)、*Doralis* spp.、履绵蚧属 (*Drosicha* spp.)、西圆尾蚜属 (*Dysaphis* spp.)、灰粉蚧属 (*Dysmicoccus* spp.)、小绿叶蝉属 (*Empoasca* spp.)、绵蚜属 (*Eriosoma* spp.)、*Erythroneura* spp.、*Euscelis bilobatus*、咖啡地粉蚧 (*Geococcus coffeae*)、假桃病毒叶蝉 (*Homalodisca coagulata*)、梅大尾蚜 (*Hyalopterus arundinis*)、吹绵蚧属 (*Icerya* spp.)、片角叶蝉属 (*Idiocerus* spp.)、扁喙叶蝉属 (*Idioscopus* spp.)、灰飞虱 (*Laodelphax striatellus*)、*Lecanium* spp.、蛎盾蚧属 (*Lepidosaphes* spp.)、萝卜蚜 (*Lipaphis erysimi*)、长管蚜属 (*Macrosiphum* spp.)、*Mahanarva* *fimbriolata*、高粱蚜 (*Melanaphis sacchari*)、*Metcalfiella* spp.、麦无网蚜 (*Metopolophium dirhodum*)、黑缘平翅斑蚜 (*Monellia costalis*)、*Monelliopsis pecanis*、瘤蚜属 (*Myzus* spp.)、莴苣衲长管蚜 (*Nasonovia ribisnigri*)、黑尾叶蝉属 (*Nephotettix* spp.)、褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*)、*Oncometopia* spp.、*Orthezia praelonga*、杨梅缘粉虱 (*Parabemisia myricae*)、*Paratrioza* spp.、片盾蚧属 (*Parlatoria* spp.)、瘿绵蚜属 (*Pemphigus* spp.)、玉米蜡蝉 (*Peregrinus maidis*)、绵粉蚧属 (*Phenacoccus* spp.)、杨平翅绵蚜 (*Phloeomyzus passerinii*)、忽布疣蚜 (*Phorodon humuli*)、*Phylloxera* spp.、苏铁褐点并盾蚧 (*Pinnaspis aspidistrae*)、臀纹粉蚧属 (*Planococcus* spp.)、梨形原绵蚧 (*Protopulvinaria pyrififormis*)、桑白盾蚧 (*Pseudaulacaspis pentagona*)、粉蚧属 (*Pseudococcus* spp.)、木虱属 (*Psylla* spp.)、金小蜂属 (*Pteromalus* spp.)、*Pyrilla* spp.、笠圆盾蚧属 (*Quadraspidotus* spp.)、*Quesada gigas*、平刺粉蚧属 (*Rastrococcus* spp.)、缢管蚜属 (*Rhopalosiphum* spp.)、黑盔蚧属 (*Saissetia* spp.)、*Scaphoidestitanus*、麦二叉

蚜 (*Schizaphis graminum*)、苏铁刺圆盾蚧 (*Selenaspidus articulatus*)、长唇基飞虱属 (*Sogata* spp.)、白背飞虱 (*Sogatella furcifera*)、*Sogatodes* spp.、*Stictocephala festina*、*Tenalaphara malayensis*、*Tinocalliscaryaefoliae*、广胸沫蝉属 (*Tomaspis* spp.)、声蚜属 (*Toxoptera* spp.)、温室粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*)、个木虱属 (*Trioza* spp.)、小叶蝉属 (*Typhlocyba* spp.)、尖盾蚧属 (*Unaspis* spp.)、*Viteus vitifolii*。

[0648] 膜翅目 (*Hymenoptera*)，例如，松叶蜂属 (*Diprion* spp.)、实叶蜂属 (*Hoplocampa* spp.)、毛蚁属 (*Lasius* spp.)、小家蚁 (*Monomorium pharaonis*)、胡蜂属 (*Vespa* spp.)。

[0649] 等足目 (*Isopoda*)，例如，鼠妇 (*Armadillidium vulgare*)、栉水虱 (*Oniscus asellus*)、球鼠妇 (*Porcellio scaber*)。

[0650] 等翅目 (*Isoptera*)，例如，散白蚁属 (*Reticulitermes* spp.)、土白蚁属 (*Odontotermes* spp.)。

[0651] 鳞翅目 (*Lepidoptera*)，例如，桑剑纹夜蛾 (*Acronicta major*)、烦夜蛾 (*Aedia leucomelas*)、地老虎属 (*Agrotis* spp.)、棉叶波纹夜蛾 (*Alabama argillacea*)、干煞夜蛾属 (*Anticarsia* spp.)、*Barathra brassicae*、棉潜蛾 (*Bucculatrix thurberiella*)、松尺蠖 (*Bupalus piniarius*)、亚麻黄卷蛾 (*Cacoecia podana*)、*Capua reticulana*、苹果小卷蛾 (*Carpocapsa pomonella*)、冬尺蛾 (*Cheimatobia brumata*)、禾草螟属 (*Chilo* spp.)、枞色卷蛾 (*Choristoneura fumiferana*)、葡萄果蠹蛾 (*Clysia ambiguella*)、*Cnaphalocerus* spp.、埃及金刚钻 (*Earias insulana*)、地中海粉斑螟 (*Ephestia kuehniella*)、黄毒蛾 (*Euproctis chrysorrhoea*)、切根虫属 (*Euxoa* spp.)、脏切夜蛾属 (*Feltia* spp.)、大蜡螟 (*Galleria mellonella*)、*Helicoverpa* spp.、实夜蛾属 (*Heliothis* spp.)、褐织蛾 (*Hofmannophila pseudospretella*)、茶长卷蛾 (*Homona magnanima*)、苹果巢蛾 (*Hyponomeuta padella*)、贪夜蛾属 (*Laphygma* spp.)、苹细蛾 (*Lithocolletis blancardella*)、绿果冬夜蛾 (*Lithophane antennata*)、豆白隆切根虫 (*Loxagrotis albicosta*)、毒蛾属 (*Lymantria* spp.)、黄褐天幕毛虫 (*Malacosoma neustria*)、甘蓝夜蛾 (*Mamestra brassicae*)、稻毛胫夜蛾 (*Mocis repanda*)、粘虫 (*Mythimna separata*)、*Oria* spp.、水稻负泥虫 (*Oulema oryzae*)、小眼夜蛾 (*Panolis flammea*)、红铃麦蛾 (*Pectinophora gossypiella*)、桔潜蛾 (*Phyllocnistis citrella*)、菜粉蝶属 (*Pieris* spp.)、菜蛾 (*Plutella xylostella*)、斜纹夜蛾属 (*Prodenia* spp.)、*Pseudaletia* spp.、大豆夜蛾 (*Pseudoplusia includens*)、玉米螟 (*Pyrausta nubilalis*)、灰翅夜蛾属 (*Spodoptera* spp.)、*Thermesiagemmatalis*、袋谷蛾 (*Tinea pellionella*)、幕谷蛾 (*Tineola bisselliella*)、栎绿卷蛾 (*Tortrix viridana*)、粉夜蛾属 (*Trichoplusia* spp.)。

[0652] 直翅目 (*Orthoptera*)，例如，家蟋 (*Acheta domesticus*)、东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*)、德国蠊 (*Blattella germanica*)、蝼蛄属 (*Gryllotalpa* spp.)、马德拉蜚蠊 (*Leucophaea maderae*)、飞蝗属 (*Locusta* spp.)、黑蝗属 (*Melanoplus* spp.)、美洲大蠊 (*Periplaneta americana*)、沙漠蝗 (*Schistocerca gregaria*)。

[0653] 蚤目 (*Siphonaptera*)，例如，角叶蚤属 (*Ceratophyllus* spp.)、印鼠客蚤 (*Xenopsylla cheopis*)。

[0654] 综合目 (*Symphyla*)，例如，*Scutigera* *immaculata*。

[0655] 缨翅目 (Thysanoptera), 例如, 稻蓟马 (*Baliothrips biformis*)、*Enneothrips flavens*、花蓟马属 (*Frankliniella* spp.)、网蓟马属 (*Heliothrips*spp.)、温室条篱蓟马 (*Hercinothrips femoralis*)、卡蓟马属 (*Kakothrips*spp.)、葡萄蓟马 (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、硬蓟马属 (*Scirtothrips*spp.)、*Taeniothrips cardamoni*、蓟马属 (*Thrips* spp.)。

[0656] 缨尾目 (Thysanura), 例如, 衣鱼 (*Lepisma saccharina*)。

[0657] 植物寄生线虫包括, 例如, 冰草鳗线虫属 (*Anguina* spp.)、滑刃线虫属 (*Aphelenchoides* spp.)、刺线虫属 (*Belonoaimus* spp.)、伞滑刃线虫属 (*Bursaphelenchus* spp.)、起绒草茎线虫 (*Ditylenchus dipsaci*)、球异皮线虫属 (*Globodera* spp.)、*Heliocotylenchus* spp.、异皮线虫属 (*Heterodera* spp.)、长针线虫属 (*Longidorus* spp.)、根结线虫属 (*Meloidogyne* spp.)、短体线虫属 (*Pratylenchus* spp.)、相似穿孔线虫 (*Radopholus similis*)、*Rotylenchus* spp.、毛刺线虫属 (*Trichodorus* spp.)、矮化线虫属 (*Tylenchorhynchus* spp.)、小垫刃线虫属 (*Tylenchulus* spp.)、半穿刺线虫 (*Tylenchulus semipenetrans*)、剑线虫属 (*Xiphinema* spp.)。

[0658] 如果合适, 本发明化合物也可以某些浓度或施用率用作除草剂、安全剂、生长调节剂或改善植物特性的试剂, 或用作杀微生物剂, 例如用作杀真菌剂、抗霉菌剂、杀细菌剂、杀病毒剂 (包括抵抗类病毒的试剂) 或用作抵抗 MLO (支原体样微生物) 和 RLO (立克次体样微生物) 的试剂。如果合适, 它们也可被用作合成其他活性化合物的中间体或前体。

[0659] 所有的植物及植物部位均可依据本发明进行处理。本发明中植物的含义应理解为所有的植物及植物种群, 例如需要的及不需要的野生植物或作物植物 (包括天然存在的作物植物)。作物植物可为可通过常规植物育种和优选法或通过生物技术和遗传工程方法或通过前述方法的结合而获得的植物, 包括转基因植物并包括受植物育种者权利 (plant breeders' right) 保护或不受其保护的植物栽培种。植物部位的含义应理解为地上及地下的所有植物部位及植物器官, 例如芽、叶、花和根, 可提及的实例有叶、针叶、茎、干、花、子实体、果实、种子、根、块茎和根茎。植物部位还包括采收物, 及无性与有性繁殖物, 例如插枝、块茎、根茎、分枝和种子。

[0660] 根据本发明用活性化合物对植物及植物部位进行的处理, 通过常规处理方法直接进行或者使化合物作用于其环境、生境或贮存空间而进行, 所述常规处理方法例如浸液、喷雾、蒸发、弥雾、撒播、涂抹、注射, 并且, 对于繁殖物, 特别是对于种子, 还可施用一层或多层包衣。

[0661] 可将活性化合物转化为常规制剂, 例如溶液剂、乳剂、可湿性粉剂、水基和油基悬浮剂、粉剂、粉末剂、膏剂、可溶性粉剂、可溶性颗粒剂、撒播颗粒剂、悬乳浓缩剂、经活性化合物浸渍的天然材料、经活性化合物浸渍的合成材料、肥料, 以及聚合物中的微胶囊剂。

[0662] 这些制剂以已知方式制备, 例如通过将活性化合物与填充剂混合, 即, 与液体溶剂和 / 或固体载体混合, 任选使用表面活性剂, 即乳化剂和 / 或分散剂和 / 或发泡剂。所述制剂在适宜的装置中制备, 或者在施用之前或施用期间制备。

[0663] 适宜用作助剂的为适于赋予组合物本身和 / 或由其得到的制剂 (例如喷雾液剂、种子包衣剂) 以特定特性的物质, 所述特性例如某些技术特性和 / 或特定的生物特性。通常适宜的助剂有: 填充剂、溶剂和载体。

[0664] 适宜的填充剂有,例如,水、极性和非极性的有机化学液剂,如芳族烃和非芳族烃类(例如石蜡、烷基苯、烷基萘、氯苯)、醇和多元醇类(如果合适,其也可以被取代、醚化和/或酯化)、酮类(例如丙酮、环己酮)、酯类(包括脂肪和油)和(聚)醚类、未被取代的和被取代的胺类、酰胺类、内酰胺(例如N-烷基吡咯烷酮)和内酯类、砜和亚砜类(例如二甲亚砜)。

[0665] 如果所用填充剂为水,还可使用例如有机溶剂作为助溶剂。适宜的液体溶剂主要有:芳族化合物,例如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯化芳族烃和氯化脂族烃,例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,例如环己烷或石蜡,如石油馏分、矿物油和植物油;醇,例如丁醇或乙二醇,及其醚和酯;酮,例如丙酮、甲乙酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂,例如二甲亚砜;以及水。

[0666] 适宜的固体载体有:

[0667] 例如铵盐和粉碎的天然矿物,如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、绿坡缕石、蒙脱石或硅藻土,以及粉碎的合成矿物,如细分散二氧化硅、氧化铝和硅酸盐;适用于颗粒剂的固体载体有:例如粉碎并分级的天然岩石,如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石,以及合成的无机及有机粉颗粒,以及有机物例如纸、锯屑、椰壳、玉米穗轴和烟草茎的颗粒;适宜的乳化剂和/或发泡剂有:例如非离子及阴离子的乳化剂,例如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚,如烷基芳基聚乙二醇醚,烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐及蛋白质水解产物;适宜的分散剂为非离子和/或离子型物质,例如醇-POE-和/或-POP-醚类、酸和/或POP-POE酯类、烷基芳基和/或POP-POE醚类、脂肪-和/或POP-POE加合物、POE-和/或POP-多元醇衍生物、POE-和/或POP-脱水山梨糖醇-或-糖加合物、烷基或芳基硫酸盐、烷基或芳基磺酸盐和烷基或芳基磷酸盐,或相应的PO-醚加合物。此外,适宜的低聚物或聚合物,例如由乙烯型单体、丙烯酸、EO和/或PO单独地或与例如(多元)醇或(多元)胺结合而得到的那些低聚物或聚合物。也可使用木素及其磺酸衍生物、未改性的和改性的纤维素、芳族和/或脂族磺酸及其与甲醛的加合物。

[0668] 制剂中可使用增粘剂,例如羧甲基纤维素,和粉末、颗粒或胶乳形式的天然及合成聚合物,例如阿拉伯树胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯;及天然磷脂,例如脑磷脂和卵磷脂,及合成磷脂。

[0669] 可使用着色剂,例如无机颜料,如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝;及有机染料,例如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料;及微量营养物质,例如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐。

[0670] 其他可用的添加剂有香料、任选改性的矿物或植物油、蜡和营养素(包括微量元素),例如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐。

[0671] 还可存在有稳定剂,例如低温稳定剂、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂或其他能改进化学和/或物理稳定性的试剂。

[0672] 所述制剂通常含有0.01至98重量%的活性化合物,优选0.5至90%。

[0673] 本发明活性化合物可以其市售可得制剂的形式和由这些制剂制备的与其他活性化合物混合的使用形式而使用,所述其他活性化合物例如杀昆虫剂、引诱剂、绝育剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、生长调节剂、除草剂、安全剂、肥料或化学信息素。

[0674] 也可与其他已知的活性化合物混合,所述活性化合物例如除草剂、肥料、生长调节

剂、安全剂、化学信息素；或与改进植物特性的试剂混合。

[0675] 当用作杀虫剂时，本发明活性化合物还可以其市售可得制剂的形式和由这些制剂制备的与增效剂混合的使用形式存在。增效剂为提高活性化合物的活性、而所添加的该增效剂本身不必具有活性的化合物。

[0676] 当用作杀虫剂时，本发明活性化合物还可以其市售可得制剂的形式和由这些制剂制备的与抑制剂混合的使用形式存在，所述抑制剂可减少活性化合物在用于植物的环境、植物部位表面或植物组织中之后的降解。

[0677] 由市售可得制剂制备的使用形式的活性化合物含量可在较宽的范围内变化。使用形式的活性化合物浓度可为 0.00000001-95 重量%的活性化合物，优选 0.00001-1 重量%之间。

[0678] 所述化合物以适合于使用形式的常规方式施用。

[0679] 如前所述，可依据本发明处理所有的植物及其部位。在一个优选的实施方案中，处理了野生植物种和植物栽培种，或由常规生物育种方法例如杂交或原生质体融合而获得的植物种和植物栽培种，及所述植物种和植物栽培种的部位。在另一个优选的实施方案中，处理了由基因工程方法——如果合适与常规方法相结合——而获得的转基因植物和植物栽培种（遗传修饰生物体），及其部位。术语“部位”、“植物的部位”和“植物部位”解释如上。

[0680] 特别优选地，依据本发明进行处理的植物为各自市售可得或正在使用的植物栽培种。植物栽培种的含义理解为由常规育种、诱变或重组 DNA 技术而获得的具有新特性（“特征”）的植物。它们可以是栽培种、生物型或基因型。

[0681] 依据植物种或植物栽培种、其种植地点和生长条件（土壤、气候、营养生长期、营养（diet）），本发明的处理也可产生超加和（“协同”）效应。由此可取得如下超过实际预期的效果，例如降低可依据本发明使用的物质和组合物的施用率和 / 或加宽其活性谱和 / 或提高其活性、改善植物生长、提高高温或低温耐受性、提高对干旱或者水或土壤含盐量的耐受性、提高开花品质、使采收更简易、加速成熟、提高采收产率、提高采收产品的品质和 / 或提高其营养价值、改善采收产品的贮存稳定性和 / 或其加工性能。

[0682] 优选依据本发明处理的转基因植物或植物栽培种（通过遗传工程而获得）包括通过基因修饰接受了遗传物质的所有植物，所述遗传物质赋予了所述植物特别有利、有用的特征。所述特征的实例有改善植物生长、提高高温或低温耐受性、提高对干旱或者水或土壤含盐量的耐受性、提高开花品质、使采收更简易、加速成熟、提高采收产率、提高采收产品的品质和 / 或提高其营养价值、改善采收产品的贮存稳定性和 / 或其加工性能。特别强调的所述特征的其他实例有改善植物对动物和微生物有害物的抵抗力，例如对昆虫、螨虫、植物致病真菌、细菌和 / 或病毒的抵抗力，以及提高植物对某些除草活性化合物的耐受性。可提及的转基因植物的实例为重要的作物植物，例如谷物（小麦、稻）、玉米、大豆、马铃薯、甜菜、西红柿、豌豆及其他蔬菜品种、棉花、烟草、油菜及水果植物（水果为苹果、梨、柑橘类水果及葡萄），并且特别强调的是玉米、大豆、马铃薯、棉花、烟草和油菜。特别强调的特征为通过在植物体内形成的毒素，特别是由苏云金杆菌（*Bacillus thuringiensis*）的遗传物质（例如通过基因 CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb 和 CryIF 及它们的结合）在植物体内形成的毒素，来提高植物对昆虫、蛛形纲动物、线虫和蛞蝓及蜗牛的抵抗力（以下简称为“Bt 植物”）。还特别强调的特征为通过

系统获得性抗性 (SAR)、系统素、植物抗毒素、引发物 (elicitor) 和抗性基因以及相应的表达蛋白质和毒素来提高植物对真菌、细菌和病毒的抵抗力。此外特别强调的特征为提高植物对某些除草活性化合物的耐受性,例如对咪唑啉酮类、磺酰脲类、草甘膦或草丁膦的耐受性(例如“PAT”基因)。赋予所述所需特征的基因也可在转基因植物体内相互结合而存在。可提及的“Bt 植物”的实例有市售的商品名为 YIELD **GARD®** (例如玉米、棉花、大豆)、**KnockOut®** (例如玉米)、**StarLink®** (例如玉米)、**Bollgard®** (棉花)、**Nucotn®** (棉花) 和 **NewLeaf®** (马铃薯) 的玉米品种、棉花品种、大豆品种和马铃薯品种。可提及的除草剂耐受性植物的实例有市售的商品名为 Roundup **Ready®** (具有草甘膦耐受性,例如玉米、棉花、大豆)、Liberty **Link®** (具有草丁膦耐受性,例如油菜)、**IMI®** (具有咪唑啉酮耐受性) 和 **STS®** (具有磺酰脲耐受性,例如玉米) 的玉米品种、棉花品种和大豆品种。可提及的除草剂抗性植物(以常规的除草剂耐受性方式育种的植物)包括名称为 **Clearfield®** (例如玉米) 的市售品种。当然,这些叙述也适用于具有所述基因特征或待开发基因特征的植物栽培种,所述植物栽培种将在未来进行开发和 / 或上市。

[0683] 所列植物可用本发明的通式 I 的化合物和 / 或活性化合物混合物以特别有利的方式依据本发明进行处理。上述关于活性化合物或混合物的优选范围也适用于对这些植物的处理。特别强调用本说明书中具体提及的化合物或混合物处理植物。

[0684] 本发明活性化合物不仅对植物害虫、卫生害虫和贮存产品害虫具有活性,而且对兽医领域中的动物寄生虫(体外寄生虫和体内寄生虫)例如硬蜱、软蜱、兽疥螨、叶螨、蝇(叮咬和吸食)、寄生蝇幼虫、虱、毛虱、羽虱和蚤也具有活性。所述寄生虫包括:

[0685] 虱目 (Anoplurida), 例如血虱属 (*Haematopinus* spp.)、毛虱属 (*Linognathus* spp.)、虱属 (*Pediculus* spp.)、Phtirus spp.、管虱属 (*Solenopotes* spp.)。

[0686] 食毛目 (Mallophagida) 和钝角亚目 (suborder Amblycerina) 及细角亚目 (*Ischnocerina*), 例如毛羽虱属 (*Trimenopon* spp.)、禽虱属 (*Menopon*spp.)、巨羽虱属 (*Trinoton* spp.)、牛羽虱属 (*Bovicola* spp.)、*Werneckiella*spp.、*Lepikentron* spp.、畜虱属 (*Damalina* spp.)、嚼虱属 (*Trichodectes*spp.)、猫羽虱属 (*Felicola* spp.)。

[0687] 双翅目及长角亚目 (suborder Nematocera) 和短角亚目 (*Brachycera*), 例如伊蚊属 (*Aedes* spp.)、按蚊属 (*Anopheles* spp.)、库蚊属 (*Culex* spp.)、蚋属 (*Simulium* spp.)、真蚋属 (*Eusimulium* spp.)、白蛉属 (*Phlebotomus* spp.)、罗蛉属 (*Lutzomyia* spp.)、库蠓属 (*Culicoides* spp.)、斑虻属 (*Chrysops* spp.)、瘤虻属 (*Hybomitra* spp.)、黄虻属 (*Atylotus* spp.)、虻属 (*Tabanus* spp.)、麻虻属 (*Haematopota* spp.)、*Philipomyia* spp.、蜂虻属 (*Braula* spp.)、家蝇属 (*Musca* spp.)、齿股蝇属 (*Hydrotaea* spp.)、螫蝇属 (*Stomoxys* spp.)、黑角蝇属 (*Haematobia* spp.)、莫蝇属 (*Morellia*spp.)、厕蝇属 (*Fannia* spp.)、舌蝇属 (*Glossina* spp.)、丽蝇属 (*Calliphora*spp.)、绿蝇属 (*Lucilia* spp.)、金蝇属 (*Chrysomya* spp.)、污蝇属 (*Wohlfahrtia* spp.)、麻蝇属 (*Sarcophaga* spp.)、狂蝇属 (*Oestrus* spp.)、皮蝇属 (*Hypoderma* spp.)、胃蝇属 (*Gasterophilus* spp.)、虱蝇属 (*Hippoboscas*spp.)、羊虱蝇属 (*Lipoptena* spp.)、蜱蝇属 (*Melophagus* spp.)。

[0688] 蚤目 (Siphonaptera), 例如蚤属 (*Pulex* spp.)、栉首蚤属 (*Ctenocephalides* spp.)、客蚤属 (*Xenopsylla* spp.)、角叶蚤属 (*Ceratophyllus*spp.)。

[0689] 异翅目 (Heteroptera), 例如臭虫属 (*Cimex* spp.)、锥猎蝽属 (*Triatoma* spp.)、

红猎蝽属 (*Rhodnius* spp.)、锥蝽属 (*Panstrongylus* spp.)。

[0690] 蜚蠊目 (*Blattarida*), 例如东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*)、美洲大蠊、德国蠊 (*Blattella germanica*)、夏柏拉蟑螂属 (*Supella* spp.)。

[0691] 蜱螨亚纲 (*Acaria*、*Acarida*) 及后气门目 (*Metastigmata*) 和中气门目 (*Mesostigmata*), 例如锐缘蜱属 (*Argas* spp.)、钝缘蜱属 (*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.)、Haemophysalis spp.、璃眼蜱属 (*Hyalomma* spp.)、扇头蜱属 (*Rhipicephalus* spp.)、皮刺螨属 (*Dermanyssus* spp.)、刺利螨属 (*Raillietia* spp.)、肺刺螨属 (*Pneumonyssus* spp.)、胸刺螨属 (*Sternostoma* spp.)、蜂螨属 (*Varroa* spp.)。

[0692] 轴螨目 (*Actiniedida*) (前气门亚目 (*Prostigmata*)) 和粉螨目 (*Acaridida*) (无气门亚目 (*Astigmata*)), 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.)、蠕形螨属 (*Demodex* spp.)、恙螨属 (*Trombicula* spp.)、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.)、痒螨属 (*Psoroptes* spp.)、皮螨属 (*Chorioptes* spp.)、耳疥螨属 (*Otodectes* spp.)、疥螨属 (*Sarcoptes* spp.)、耳螨属 (*Notoedres* spp.)、疙螨属 (*Knemidocoptes* spp.)、气囊螨属 (*Cytodites* spp.)、鸡雏螨属 (*Laminosioptes* spp.)。

[0693] 本发明式 (I) 的活性化合物也适用于防治侵扰以下动物的节肢动物: 农业生产性家畜, 例如牛、绵羊、山羊、马、猪、驴、骆驼、水牛、兔、家鸡、火鸡、鸭、鹅和蜜蜂; 其他宠物类, 例如狗、猫、笼鸟和观赏鱼; 以及所谓的试验性动物, 例如仓鼠、豚鼠、大鼠和小鼠。通过防治所述节肢动物, 将会减少死亡率和产量 (肉、奶、毛、皮、蛋、蜜等) 的降低, 从而通过使用本发明活性化合物可使畜牧业更经济和更简便。

[0694] 本发明的活性化合物以已知方式通过以下给药形式用于兽医领域和畜牧业中: 通过例如片剂、胶囊剂、饮剂、兽用顿服药、颗粒剂、膏剂、丸剂、喂服 (feed-through) 法和栓剂的方式进行肠内给药; 通过例如注射 (肌内、皮下、静脉内、腹膜内等)、植入进行肠胃外给药; 通过鼻部给药; 以例如浸渍或沐浴 (bathing)、喷雾、浇注 (pouring on) 和点滴、清洗和撒粉的形式, 以及借助于含有活性化合物的模型制品例如颈圈、耳标、尾标、肢体缚带 (limb band)、笼头、标识器等进行皮肤给药。

[0695] 用于家畜、家禽、宠物等时, 式 (I) 的活性化合物可作为含有 1-80 重量% 活性化合物的制剂 (例如粉剂、乳剂、可流动剂) 直接使用或稀释 100-10000 倍后使用, 或者它们可作为化学溶剂使用。

[0696] 此外还发现本发明化合物对毁坏工业材料的昆虫具有强的杀昆虫作用。

[0697] 以下昆虫可作为实例和优选——但不进行任何限制地——提及:

[0698] 甲虫, 例如北美家天牛 (*Hylotrupes bajulus*)、*Chlorophorus pilosis*、家具窃蠹 (*Anobium punctatum*)、报死窃蠹 (*Xestobium rufovillosum*)、梳角细脉窃蠹 (*Ptilinus pecticornis*)、*Dendrobium pertinex*、松窃蠹 (*Ernobius mollis*)、*Priobium carpini*、褐粉蠹 (*Lyctus brunneus*)、非洲粉蠹 (*Lyctus africanus*)、南方粉蠹 (*Lyctus planicollis*)、

栎粉蠹 (*Lyctus linearis*)、柔毛粉蠹 (*Lyctus pubescens*)、*Trogoxylon aequale*、鳞毛粉蠹 (*Minthesrugicollis*)、材小蠹种 (*Xyleborus spec.*)、*Tryptodendron spec.*、咖啡黑长蠹 (*Apate monachus*)、榲长蠹 (*Bostrychus capucins*)、褐异翅长蠹 (*Heterobostrychus brunneus*)、棘长蠹种 (*Sinoxylon spec.*)、竹长蠹 (*Dinoderus minutus*)；

[0699] 膜翅目昆虫 (*Hymenopteron*)，例如大树蜂 (*Sirex juvenicus*)、枞大树蜂 (*Urocerus gigas*)、泰加大树蜂 (*Urocerus gigas taignus*)、*Urocera augur*；

[0700] 白蚁，例如欧洲木白蚁 (*Kaloterms flavicollis*)、麻头堆砂白蚁 (*Cryptotermes brevis*)、灰点异白蚁 (*Heterotermes indicola*)、欧美散白蚁 (*Reticulitermes flavipes*)、桑特散白蚁 (*Reticulitermes santonensis*)、南欧网纹白蚁 (*Reticulitermes lucifugus*)、达尔文澳白蚁 (*Mastotermes darwiniensis*)、内华达古白蚁 (*Zootermopsis nevadensis*)、家白蚁 (*Coptotermes formosanus*)；

[0701] 蠹虫 (*Bristletail*)，例如衣鱼。

[0702] 本发明中工业材料的含义应理解为非活体材料，例如，优选塑料、粘合剂、胶料、纸张和纸板、皮革、木材及加工的木材制品和涂料组合物。

[0703] 即用型组合物 -- 如果合适 -- 可含有其他杀虫剂，和 -- 如果合适 -- 一种或多种杀菌剂。

[0704] 关于可用的其他添加剂，可提及的有上文所述的杀虫剂和杀菌剂。

[0705] 本发明化合物也可用于保护与盐水或微咸水接触的物体，例如船体、筛、网、建筑物、系泊设备及信号系统，以防产生污垢。

[0706] 此外，本发明化合物可单独地或与其他活性化合物结合而用作防污剂。

[0707] 在家用产品、卫生产品和贮存产品的保护中，活性化合物也适于防治在封闭空间内发现的动物有害物，特别是昆虫、蛛形纲动物和螨虫，所述封闭空间例如住所、工厂车间、办公室、交通工具舱等。它们可单独地或与其他活性化合物和助剂结合而用在家用杀虫产品中用于防治这些害虫。它们对敏感的和抗性的物种以及对全部发育阶段均具有活性。所述害虫包括：

[0708] 蝎目 (*Scorpionidea*)，例如地中海黄蝎 (*Buthus occitanus*)。

[0709] 蜱螨目，例如波斯锐缘蜱 (*Argas persicus*)、鸽锐缘蜱 (*Argas reflexus*)、苔螨亚种 (*Bryobia ssp.*)、鸡皮刺螨、家嗜甜螨 (*Glyciphagus domesticus*)、非洲钝缘蜱 (*Ornithodoros moubat*)、血红扇头蜱 (*Rhipicephalus sanguineus*)、阿氏真恙螨 (*Trombicula alfreddugesi*)、*Neutrombicula autumnalis*、特嗜皮螨 (*Dermatophagoides pteronissimus*)、法嗜皮螨 (*Dermatophagoides forinae*)。

[0710] 蜘蛛目 (*Araneae*)，例如捕鸟蛛 (*Aviculariidae*)、圆蛛 (*Araneidae*)。

[0711] 盲蛛目 (*Opiliones*)，例如螯蝎 (*Pseudoscorpiones chelifer*)、*Pseudoscorpiones cheiridium*、长跗盲蛛 (*Opiliones phalangium*)。

[0712] 等足目，例如栉水虱、球鼠妇。

[0713] 倍足目，例如 *Blaniulus guttulatus*、山蛰虫属 (*Polydesmus spp.*)。

[0714] 唇足目，例如地蜈蚣属。

[0715] 衣鱼目 (*Zygentoma*)，例如栉衣鱼属 (*Ctenolepisma spp.*)、衣鱼、盗火虫 (*Lepismodes inquilinus*)。

[0716] 蜚蠊目,例如东方蜚蠊、德国蠊、亚洲蠊 (*Blattella asahinai*)、马德拉蜚蠊、角腹蠊属 (*Panchlora* spp.)、木蠊属 (*Parcoblatta* spp.)、澳洲大蠊 (*Periplaneta australasiae*)、美洲大蠊、大褐大蠊 (*Periplaneta brunnea*)、烟色大蠊 (*Periplaneta fuliginosa*)、棕带蜚蠊 (*Supella longipalpa*)。

[0717] 跳跃目 (*Saltatoria*),例如家蟋。

[0718] 革翅目,例如欧洲球螋。

[0719] 等翅目,例如木白蚁属 (*Kaloterms* spp.)、散白蚁属。

[0720] 啮虫目 (*Psocoptera*),例如 *Lepinatus* spp.、粉啮虫属 (*Liposcelis* spp.)。

[0721] 鞘翅目 (*Coleptera*),例如圆皮蠹属、毛皮蠹属、皮蠹属、长头谷盗 (*Latheticus oryzae*)、隐跗郭公虫属 (*Necrobia* spp.)、蛛甲属、谷蠹、谷象 (*Sitophilus granarius*)、米象 (*Sitophilus oryzae*)、玉米象 (*Sitophilus zeamais*)、药材甲 (*Stegobium paniceum*)。

[0722] 双翅目,例如埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*)、白纹伊蚊 (*Aedes albopictus*)、带喙伊蚊 (*Aedes taeniorhynchus*)、按蚊属、红头丽蝇、高额麻虻 (*Chrysosona pluvialis*)、五带淡色库蚊 (*Culex quinquefasciatus*)、尖音库蚊 (*Culex pipiens*)、环喙库蚊 (*Culex tarsalis*)、果蝇属 (*Drosophila* spp.)、夏厕蝇 (*Fannia canicularis*)、家蝇 (*Musca domestica*)、白蛉属、肉蝇 (*Sarcophaga carnaria*)、蚋属、厩螯蝇 (*Stomoxys calcitrans*)、欧洲大蚊。

[0723] 鳞翅目,例如小蜡螟 (*Achroia grisella*)、大蜡螟、印度谷螟 (*Plodia interpunctella*)、木塞谷蛾 (*Tinea cloacella*)、袋谷蛾、幕谷蛾。

[0724] 蚤目,例如犬栉首蚤 (*Ctenocephalides canis*)、猫栉首蚤 (*Ctenocephalides felis*)、人蚤 (*Pulex irritans*)、穿皮潜蚤 (*Tungapenetrans*)、印鼠客蚤。

[0725] 膜翅目,例如广布弓背蚁 (*Camponotus herculeanus*)、黑臭蚁 (*Lasius fuliginosus*)、黑蚁 (*Lasius niger*)、*Lasius umbratus*、小家蚁、*Paravespula* spp.、铺道蚁 (*Tetramorium caespitum*)。

[0726] 虱目 (*Anoplura*),例如头虱 (*Pediculus humanus capitis*)、体虱 (*Pediculus humanus corporis*)、瘰绵蚜属 (*Pemphigus* spp.)、*Phylloeravastatrix*、阴虱 (*Phthirus pubis*)。

[0727] 异翅目,例如热带臭虫 (*Cimex hemipterus*)、温带臭虫 (*Cimex lectularius*)、长红猎蝽 (*Rhodinus prolixus*)、侵扰锥猎蝽 (*Triatoma infestans*)。

[0728] 在家用杀虫剂领域中,它们单独地或与其他适宜的活性化合物结合而使用,所述适宜的活性化合物例如磷酸酯类、氨基甲酸酯类、拟除虫菊酯类、新烟碱类、生长调节剂或其他已知杀虫剂类活性化合物。

[0729] 它们可以用于以下产品中:气雾剂、无压喷雾产品,例如泵喷雾和雾化器喷雾、自动雾化系统、雾化剂、泡沫剂、凝胶剂;具有由纤维素或聚合物制得的蒸发器片的蒸发产品,液态蒸发剂、凝胶和膜蒸发剂,推进器驱动的蒸发剂,无动力或无源蒸发系统;捕蛾纸、捕蛾袋和捕蛾胶,作为颗粒剂或粉末剂用于抛撒的饵料中或毒饵站 (bait station) 中。

[0730] 本发明的活性化合物也可用作脱叶剂、干燥剂、除茎叶剂 (haulm killer),并且特别是用作除杂草剂。最广义的杂草应理解为意指在不需要它们的地方生长的所有植物。本发明物质用作非选择性还是选择性除草剂,主要取决于施用率。

[0731] 本发明活性化合物可用于例如以下植物中：

[0732] 以下属的双子叶杂草：白麻属 (Abutilon)、苋属 (Amaranthus)、豚草属 (Ambrosia)、Anoda、春黄菊属 (Anthemis)、Aphanes、滨藜属 (Atriplex)、雏菊属 (Bellis)、鬼针属 (Bidens)、芥属 (Capsella)、飞廉属 (Carduus)、决明属 (Cassia)、矢车菊属 (Centaurea)、藜属 (Chenopodium)、蓟属 (Cirsium)、旋花属 (Convolvulus)、曼陀罗属 (Datura)、山蚂蝗属 (Desmodium)、刺酸模属 (Emex)、糖芥属 (Erysimum)、大戟属 (Euphorbia)、鼬瓣花属 (Galeopsis)、牛膝菊属 (Galinsoga)、拉拉藤属 (Galium)、芙蓉属 (Hibiscus)、番薯属 (Ipomoea)、地肤属 (Kochia)、野芝麻属 (Lamium)、独行菜属 (Lepidium)、母草属 (Lindernia)、母菊属 (Matricaria)、薄荷属 (Mentha)、山黧属 (Mercurialis)、Mullugo、勿忘我属 (Myosotis)、罂粟属 (Papaver)、牵牛属 (Pharbitis)、车前属 (Plantago)、蓼属 (Polygonum)、马齿苋属 (Portulaca)、毛茛属 (Ranunculus)、萝卜属 (Raphanus)、蔊菜属 (Rorippa)、节节菜属 (Rotala)、酸模属 (Rumex)、猪毛菜属 (Salsola)、千里光属 (Senecio)、田菁属 (Sesbania)、黄花稔属 (Sida)、白芥属 (Sinapis)、茄属 (Solanum)、苦苣菜属 (Sonchus)、尖瓣花属 (Sphenoclea)、繁缕属 (Stellaria)、蒲公英属 (Taraxacum)、苣荬菜属 (Thlaspi)、车轴草属 (Trifolium)、荨麻属 (Urtica)、婆婆纳属 (Veronica)、堇菜属 (Viola)、苍耳属 (Xanthium)。

[0733] 以下属的双子叶作物：花生属 (Arachis)、甜菜属 (Beta)、芸苔属 (Brassica)、黄瓜属 (Cucumis)、南瓜属 (Cucurbita)、向日葵属 (Helianthus)、胡萝卜属 (Daucus)、大豆属 (Glycine)、棉属 (Gossypium)、番薯属 (Ipomoea)、莴苣属 (Lactuca)、亚麻属 (Linum)、番茄属 (Lycopersicon)、烟草属 (Nicotiana)、菜豆属 (Phaseolus)、豌豆属 (Pisum)、茄属 (Solanum)、蚕豆属 (Vicia)。

[0734] 以下属的单子叶杂草：山羊草属 (Aegilops)、冰草属 (Agropyron)、剪股颖属 (Agrostis)、看麦娘属 (Alopecurus)、Apera、燕麦属 (Avena)、臂形草属 (Brachiaria)、雀麦属 (Bromus)、蒺藜草属 (Cenchrus)、鸭跖草属 (Commelina)、狗牙根属 (Cynodon)、莎草属 (Cyperus)、龙爪茅属 (Dactyloctenium)、马唐属 (Digitaria)、稗属 (Echinochloa)、荸荠属 (Eleocharis)、蟋蟀草属 (Eleusine)、画眉草属 (Eragrostis)、野黍属 (Eriochloa)、羊茅属 (Festuca)、飘拂草属 (Fimbristylis)、异蕊花属 (Heteranthera)、白茅属 (Imperata)、鸭嘴草属 (Ischaemum)、千金子属 (Leptochloa)、黑麦草属 (Lolium)、雨久花属 (Monochoria)、黍属 (Panicum)、雀稗属 (Paspalum)、藨草属 (Phalaris)、梯牧草属 (Phleum)、早熟禾属 (Poa)、筒轴茅属 (Rottboellia)、慈姑属 (Sagittaria)、莞草属 (Scirpus)、狗尾草属 (Setaria)、高粱属 (Sorghum)。

[0735] 以下属的单子叶作物：葱属 (Allium)、凤梨属 (Ananas)、天门冬属 (Asparagus)、燕麦属 (Avena)、大麦属 (Hordeum)、稻属 (Oryza)、黍属 (Panicum)、甘蔗属 (Saccharum)、黑麦属 (Secale)、高粱属 (Sorghum)、小黑麦属 (Triticale)、小麦属 (Triticum)、玉蜀黍属 (Zea)。

[0736] 但是，本发明活性化合物的用途决不限于所述属，而是以相同方式扩展至其他植物。

[0737] 依据浓度，本发明活性化合物适于在例如工业地带和铁道以及有树和无树的道路和场所中用于非选择性地防治杂草。本发明活性化合物也可用于防治多年生作物中

的杂草,所述多年生作物例如森林、观赏性树木栽植、果园、葡萄园、柑桔林、坚果园、香蕉种植园、咖啡种植园、茶叶种植园、橡胶种植园、油椰种植园、可可种植园、无核水果 (soft fruit) 种植园和蛇麻田 (hop field)、草坪、草地和牧场 ;和用于选择性防治一年生作物中的杂草。

[0738] 本发明活性化合物在用于土壤和地上植物部位时具有强的除草活性和较宽的活性谱。在某种程度上,它们也适于选择性防治单子叶和双子叶作物中的单子叶和双子叶杂草,出苗前和出苗后均可。

[0739] 以某些浓度或施用率,本发明活性化合物也可用于防治动物有害物及真菌或细菌植物病害。如果合适,它们还可用作合成其他活性化合物的中间体或前体。

[0740] 可将本发明活性化合物转化为常规制剂,例如溶液剂、乳剂、可湿性粉剂、悬浮剂、粉剂、粉末剂、膏剂、可溶性粉剂、颗粒剂、悬乳浓缩剂、经活性化合物浸渍的天然及合成材料,以及聚合物中的微胶囊。

[0741] 这些制剂以已知方式制备,例如通过将活性化合物与填充剂混合,即与液体溶剂和 / 或固体载体混合而制备,任选使用表面活性剂,即乳化剂和 / 或分散剂和 / 或发泡剂。

[0742] 如果所用填充剂为水,还可使用例如有机溶剂作为助溶剂。适宜的液体溶剂主要有:芳族化合物,例如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯化芳族烃和氯化脂族烃,例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,例如环己烷或石蜡,如石油馏分、矿物油和植物油;醇,例如丁醇或乙二醇,及其醚和酯;酮,例如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂,例如二甲基甲酰胺和二甲亚砷;以及水。

[0743] 适宜的固体载体有:例如铵盐和粉碎的天然矿物,例如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、绿坡缕石、蒙脱石或硅藻土,以及粉碎的合成矿物,例如细分散二氧化硅、氧化铝和硅酸盐;适用于颗粒剂的固体载体有:例如粉碎并分级的天然岩石,如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石,以及合成的无机及有机粉颗粒,以及有机物例如锯屑、椰壳、玉米穗轴和烟草茎的颗粒;适宜的乳化剂和 / 或发泡剂有:例如非离子及阴离子型乳化剂,例如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚如烷基芳基聚乙二醇醚,烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐及蛋白质水解产物;适宜的分散剂有:例如木素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

[0744] 制剂中可使用增粘剂,例如羧甲基纤维素以及粉末、颗粒或胶乳形式的天然及合成聚合物,如阿拉伯树胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯,以及天然磷脂,例如脑磷脂和卵磷脂,以及合成磷脂。其他可用的添加剂为矿物油和植物油。

[0745] 可使用着色剂,例如无机颜料,如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝,以及有机染料,例如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料,以及微量营养素如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐。

[0746] 制剂一般含有 0.1-95 重量%的活性化合物,优选 0.5-90%。

[0747] 本发明活性化合物本身或其制剂也可与已知除草剂和 / 或与改善作物植物耐受性的物质 (“安全剂”) 混合用于杂草防治目的,即用混合或桶内混合 (tank mix) 均可。由此也可与含有一种或多种已知除草剂和一种安全剂的除草剂产品混合。

[0748] 也可与其他已知活性化合物混合,所述其他已知活性化合物例如杀真菌剂、杀昆虫剂、杀螨虫剂、杀线虫剂、驱鸟剂、植物营养素及土壤改良剂混合。

[0749] 本发明活性化合物可以其本身、其制剂形式或由其通过进一步稀释而制备的使用

形式施用,所述使用形式例如即用溶液、悬浮剂、乳剂、粉剂、膏剂和颗粒剂。它们以常规方式施用,例如通过浇注、喷雾、雾化、撒播 (spreading)。

[0750] 本发明活性化合物既可在植物出苗前也可在植物出苗后施用。还可将它们在种植前掺入土壤中。

[0751] 活性化合物的施用率可在非常宽的范围内变化。这主要取决于所需效果的性质。一般而言,施用率在 1g 至 10kg 活性化合物 / 公顷土壤面积之间,优选在 5g 至 5kg 活性化合物 / 公顷之间。

[0752] 本发明活性化合物结合物与作物植物的相容性的有利效果在某些浓度比例时特别显著。但是,活性化合物结合物中各活性化合物的重量比可在相对宽的范围内变化。一般而言,每重量份式 (I) 活性化合物中存在 0.001-1000 重量份、优选 0.01-100 重量份、特别优选 0.05-20 重量份的一种上面提及的 (b') 组的改进作物植物相容性的化合物 (解毒剂 / 安全剂) 之一的盐。

[0753] 本发明活性化合物通常以制得的制剂的形式施用。但是,活性化合物结合物中所含的活性化合物可作为单个制剂施用,也可在使用过程中进行混合,即以桶混物的形式施用。

[0754] 对于某些施用,特别是通过出苗后方法进行施用,制剂中包括植物耐受性矿物油或植物油 (例如市售制剂 "Rako Binol"),或铵盐如硫酸铵或硫氰酸铵,作为其他添加剂,可能更有利。

[0755] 本发明的新的活性化合物可以其本身、其制剂形式、或由所述制剂通过进一步稀释制得的使用形式使用,所述使用形式例如即用溶液剂、悬浮剂、乳剂、粉剂、膏剂和颗粒剂。可以常规方式施用,例如通过浇灌、喷雾、雾化、撒粉或撒播而施用。

[0756] 本发明活性化合物的施用率可在一定范围内变化;这尤其取决于气候及土壤因素。一般而言,施用率在 0.001 和 5kg/ha 之间,优选 0.005 和 2kg/ha 之间,特别优选 0.01 和 0.5kg/ha 之间。

[0757] 本发明活性化合物可在植物出苗前或出苗后施用,即通过出苗前方法和出苗后方法施用。

[0758] 根据安全剂的特性,本发明所用安全剂可用于预处理作物植物的种子 (拌种) 或可播种前引入播种沟 (seed furrow),或者在植物出苗前或出苗后在除草剂之前单独使用或与除草剂一起使用。

[0759] 可提及的植物的实例为重要的作物植物,例如谷类 (小麦、大麦、稻)、玉米、大豆、马铃薯、棉花、油菜、甜菜、甘蔗以及果树 (水果有苹果、梨、柑橘类水果及葡萄藤),更强调的是谷类、玉米、大豆、马铃薯、棉花及油菜。

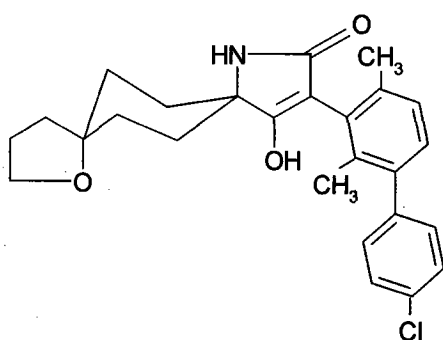
[0760] 术语 "活性化合物" 总是也包括本文提及的活性化合物结合物。

[0761] 本发明活性化合物的制备和用途通过以下实施例进行示例说明。

[0762] 制备实施例:

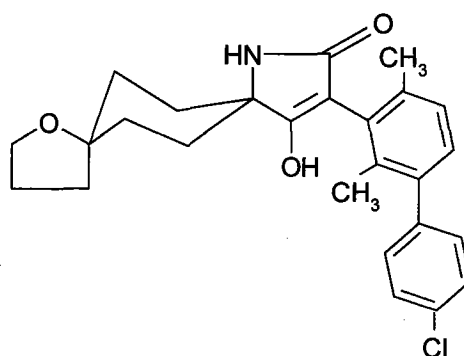
[0763] 实施例 I-1-a-1、I-1-a-2

[0764]



[0765] I-1-a-1

[0766] α 异构体



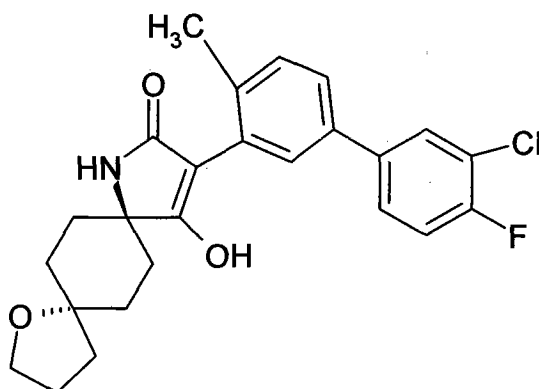
I-1-a-2

β 异构体

[0767] 首先将 0.95g (8.5mmol) 叔丁醇钾加入 3ml N,N-二甲基乙酰胺 (DMA) 中。在 60℃, 逐滴添加 1.6g (3.4mmol) 实施例 II-1 的化合物, 并继续搅拌 1.5h。将该反应混合物倒入冰水中, 用稀盐酸酸化, 并抽吸过滤。将剩余物通过硅胶中压色谱法使用环己烷 / 乙酸乙酯梯度 (50% -80%) 进行预纯化。通过 HPLC (Kromasil 100C18) 使用 43 : 56 : 1 的乙腈 / 水 / 甲酸进行进一步纯化, 得到 0.16g (理论值的 10.7%) 熔点 311℃ 的化合物 I-1-a-1 以及 0.08g (理论值的 5.4%) 熔点 307℃ 的化合物 I-1-a-2。

[0768] 实施例 I-1-a-46

[0769]

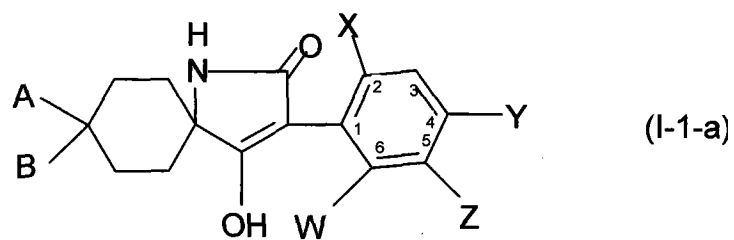


[0770] 首先将 0.588g (1.5mmol) 实施例 I-1-a-28 的化合物、0.314g (1.8mmol) 3-氯-4-氟苯基硼酸和 0.8g (7.5mmol) 碳酸钠加入 15ml 水中, 添加 37mg (0.15mmol) 硝酸钡 (II) 二水合物, 并将该混合物在预热的油浴中于 130℃ 搅拌过夜。冷却之后, 将该混合物用稀盐酸酸化, 并抽吸过滤。将水相用二氯甲烷萃取, 并将有机相用硫酸钠干燥、过滤和浓缩。这两部分一起通过 MPLC 在反相柱上使用环己烷 +0-40% 丙酮 (梯度) 纯化。

[0771] 产量: 0.25g (=理论值的 37%), m. p. 259℃

[0772] 以类似于实施例 (I-1-a-1)、(I-1-a-2)、(I-1-a-46) 的方式并根据制备方法的总的说明, 获得以下式 (I-1-a) 的化合物

[0773]



[0774]

实施例 序号	W	X	Y	Z	A B	熔点 ℃	异构体
I-1-a-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	314	α: β 约 19:1
I-1-a-4	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	281	α: β 约 3 : 7
I-1-a-5	CH ₃	CH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	316	α
I-1-a-6	CH ₃	CH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	289	α: β 约 2 : 3
I-1-a-7	CH ₃	CH ₃	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	300	α
I-1-a-8	CH ₃	CH ₃	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	273	α: β 约 3 : 7

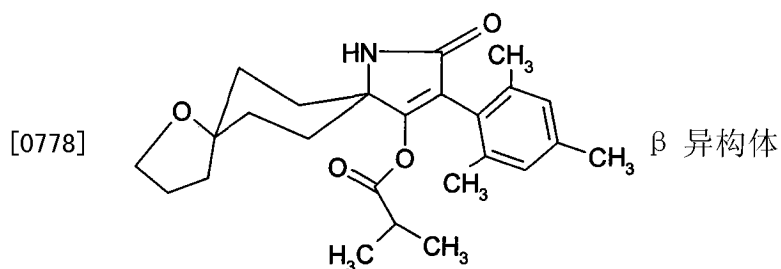
[0775]

实施例 序号	W	X	Y	Z	A B	熔点 ℃	异构体
I-1-a-9	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	266	α
I-1-a-10	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	261	α : β 约 5 : 4
I-1-a-11	C ₂ H ₅	OCH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	226	混合物 α + β
I-1-a-12	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	159	α : β 约 1 : 6
I-1-a-13	Cl	OCH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	216	混合物
I-1-a-14	CH ₃	CH ₃	H	Br	-O-(CH ₂) ₃ -	280	α : β 约 1 : 4
I-1-a-15	CH ₃	CH ₃	H	Br	-O-(CH ₂) ₃ -	286	α
I-1-a-16	H	CH ₃	Cl	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	270	β
I-1-a-17	H	CH ₃	Cl	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	265	α
I-1-a-18	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	134	α : β 3 : 7
I-1-a-19	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	271	α
I-1-a-20	Br	Br	OCF ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	油状	β
I-1-a-21	Br	Br	OCF ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	275	α
I-1-a-22	CH ₃	CH ₃		H	-O-(CH ₂) ₃ -	274	α : β 约 7 : 3
I-1-a-23	CH ₃	CH ₃		H	-O-(CH ₂) ₃ -	269	α : β 约 1 : 10
I-1-a-24	CH ₃	CH ₃	I	H	-O-(CH ₂) ₃ -	267	α : β 约 2 : 1
I-1-a-25	CH ₃	CH ₃	I	H	-O-(CH ₂) ₃ -	282	α
I-1-a-26	H	Cl	F	H	-O-(CH ₂) ₃ -	269	混合物
I-1-a-27	H	Cl	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	281	混合物
I-1-a-28	H	CH ₃	H	Br	-O-(CH ₂) ₃ -	油状	α + β 约 7 : 2
I-1-a-29	H	CH ₃	H	Br	-O-(CH ₂) ₃ -	261	β
I-1-a-30	H	Br	H	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	236	混合物
I-1-a-31	H	CH ₃	H	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	220	α + β 约 1 : 1
I-1-a-32	H	CH ₃	H	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	234	α
I-1-a-33	H	Cl	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	248	混合物
I-1-a-34	H	CH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	237	α : β

[0776]

实施例 序号	W	X	Y	Z	A B	熔点 ℃	异构体
							约 1:2
I-1-a-35	H	CH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	267	α
I-1-a-36	H	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	244	α : β 约 2:1
I-1-a-37	H	CH ₃	F	H	-O-(CH ₂) ₃ -	265	α : β 约 1:1
I-1-a-38	H	CH ₃	F	H	-O-(CH ₂) ₃ -	283	α
I-1-a-39	H	CH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	276	α : β 约 1:1
I-1-a-40	CH ₃	OCH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	271	β
I-1-a-41	CH ₃	OCH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	268	α
I-1-a-42	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	237	α
I-1-a-43	H	CH ₃	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	225	α
I-1-a-44	H	CH ₃	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	247	β
I-1-a-45	H	CH ₃	H	3,4-F ₂ -Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	256	α : β 约 9:1
I-1-a-46	H	CH ₃	H	3-Cl,4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	259	α
I-1-a-47	CH ₃	Cl	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	316-318	β
I-1-a-48	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	301-304	β
I-1-a-49	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	300-302	α
I-1-a-50	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	288-290	β
I-1-a-51	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	220-223	α
I-1-a-52	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	307-310	β
I-1-a-53	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	248-250	α
I-1-a-54	C ₂ H ₅		CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	215-219	α
I-1-a-55	C ₂ H ₅		CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	293-295	β
I-1-a-56	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	202-206	α
I-1-a-57	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	259-263	β
I-1-a-58	CH ₃	Cl	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	291-294	α

[0777] 实施例 I-1-b-1

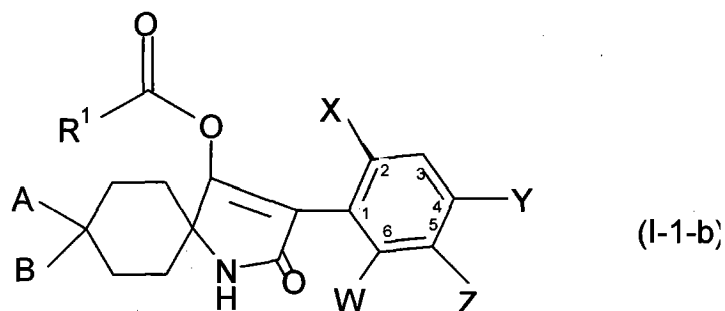


[0779] 首先将 0.512g (1.5mmol) 实施例 (I-1-a-4) 的化合物加入 15ml 乙酸乙酯 (EA) 中,

并添加 0.21ml (1.5mmol) 三乙胺和 10mg 4-N, N- 二甲基氨基吡啶。在回流状态下, 逐滴添加 0.16ml (1.5mmol) 异丁酰氯在 1.5ml EA 中的溶液, 并将该混合物再搅拌 2h。冷却后, 浓缩该混合物, 并将剩余物通过 MPLC 在硅胶上用 7 : 3 的环己烷 / 丙酮进行色谱法纯化。这样得到 0.46g (理论值的 70%) 熔点 211℃ 的产物。

[0780] 以类似于实施例 (I-1-b-1) 的方式并根据制备方法的总的说明, 获得以下式 (I-1-b) 化合物

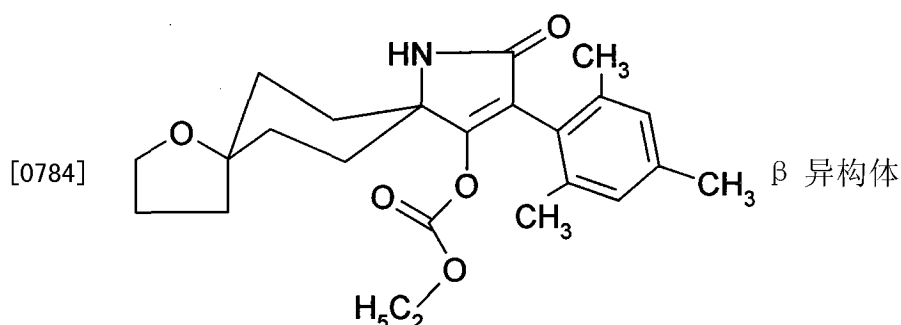
[0781]



[0782]

实施例 序号	W	X	Y	Z	A B	R ¹	熔点 ℃	异构体
I-1-b-2	CH ₃	CH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	241	α: β 约 1:1
I-1-b-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	236	α
I-1-b-4	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -		235	α
I-1-b-5	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -		236	β
I-1-b-6	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃ O-CH ₂ -	206	α
I-1-b-7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃ O-CH ₂ -	分解	β

[0783] 实施例 I-1-c-1

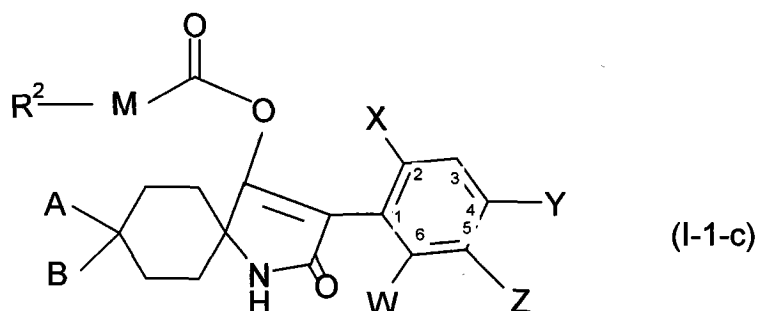


[0785] 首先将 350mg 实施例 (I-1-a-4) 的化合物加入 10ml 二氯甲烷中, 并添加 0.14ml 三乙胺。在室温下, 逐滴添加 0.1ml 氯甲酸乙酯在 1ml 二氯甲烷中的溶液, 并继续搅拌 2h。蒸发掉溶剂并将剩余物通过 MPLC 在硅胶上用 7 : 3 的环己烷 / 丙酮进行色谱法纯化。将得到的部分浓缩并溶入甲醇, 并将该产物用水沉淀出来和抽吸过滤。产量: 0.11g (理论值

的 25%), 熔点 197℃。

[0786] 以类似于实施例 (I-1-c-1) 的方式并根据制备方法的总的说明, 获得以下式 (I-1-c) 化合物

[0787]



[0788]

实施例序号	W	X	Y	Z	A B	M	R ²	熔点 ℃	异构 体
I-1-c-2	CH ₃	CH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	227	α
I-1-c-3	CH ₃	CH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	208	α: β 约 87:12
I-1-c-4	CH ₃	CH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	*	β
I-1-c-5	CH ₃	CH ₃	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	216	β
I-1-c-6	CH ₃	CH ₃	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	分解	α
I-1-c-7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	220	α
I-1-c-8	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	Ph-CH ₂ -	199	α
I-1-c-9	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	Ph-CH ₂ -	215	β
I-1-c-10	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	175-177	β
I-1-c-11	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	190-193	β

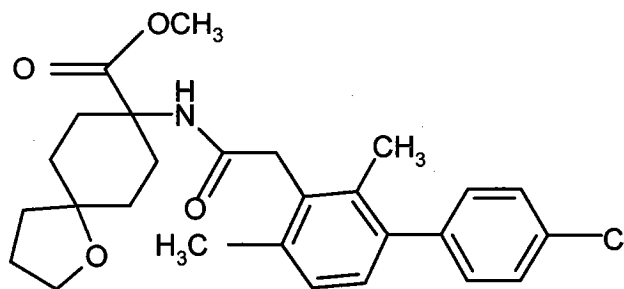
[0789]

实施例序号	W	X	Y	Z	A B	M	R ²	熔点 ℃	异构 体
I-1-c-12	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	187-189	β
I-1-c-13	C ₂ H ₅		CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	206-207	β
I-1-c-14	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	172-174	β
I-1-c-15	CH ₃	Cl	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	217-219	β
I-1-c-16	CH ₃	C ₂ H ₅	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	183-185	β
I-1-c-17	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	199-201	α
I-1-c-18	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	189-191	α
I-1-c-19	C ₂ H ₅		CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	218-221	α
I-1-c-20	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	211-213	α
I-1-c-21	CH ₃	Cl	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	213-215	α

[0790] * ¹H-NMR(400MHz, CD₃CN): δ = 1.01(t, 3H, CO₂CH₂CH₃), 2.11(s, 6H, 2x Ar-CH₃), 3.73(cm, 2H, O-CH₂), 3.97-4.03(q, 2H, CO₂CH₂CH₃) ppm

[0791] 实施例 II-1

[0792]



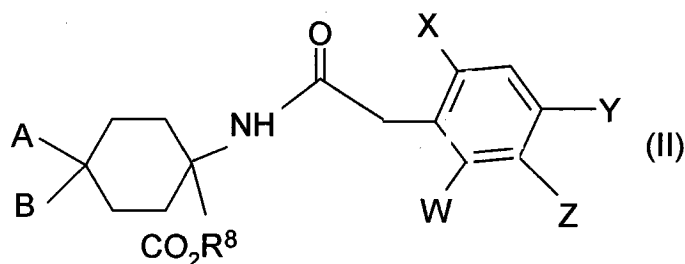
[0793] 首先将 2.75g 实施例 (XVI-1) 的化合物加入 20ml 乙酸乙酯中, 在 0℃ 添加 11ml 氢氧化钠水溶液, 然后在剧烈搅拌下, 同时添加溶于 10ml 乙酸乙酯中的 2.75g 2,6-二甲基-3-(4-氯苯基)苯乙酰胺和剩余的氢氧化钠水溶液 (10ml)。反应结束后, 分离各相, 水相用乙酸乙酯萃取, 并将合并的有机相用硫酸钠干燥、过滤并浓缩。

[0794] MPLC: 环己烷 + 30-50% 乙酸乙酯

[0795] 产量: 2g (理论值的 40%), 熔点 172.8℃

[0796] 以类似于实施例 (II-1) 的方式并根据制备方法的总的说明, 获得以下式 (II) 化合物

[0797]



[0798]

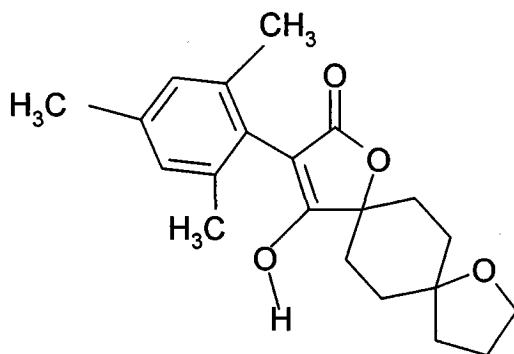
实施例 序号	W	X	Y	Z	A B	R ⁸	熔点 ℃	异构体
II-2	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	157	混合物
II-3	CH ₃	CH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	181	混合物
II-4	CH ₃	CH ₃	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	194	混合物
II-5	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	146	混合物
II-6	C ₂ H ₅	OCH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	142	混合物
II-7	H	CH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	149	α: β 约 1:1
II-8	H	Br	H	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	151	α: β 约 1:1
II-9	H	Cl	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	112	α: β 约 1:1
II-10	H	CH ₃	F	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	160	α: β 约 1:1
II-11	H	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	115	α: β 约 1:1
II-12	H	CH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	141	α: β 约 1:1
II-13	H	Cl	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	150	α: β 约 1:1
II-14	H	CH ₃	H	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	160	α: β 约 1:1
II-15	H	CH ₃	H	Br	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	148	α: β 约 1:1
II-16	H	Cl	F	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	145	α: β 约 1:1
II-17	CH ₃	CH ₃	I	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	211	α: β 约 1:1
II-18	CH ₃		CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	188	α: β 约 1:1
II-19	Br	Br	OCF ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	186	α: β 约 1:1

[0799]

实施例 序号	W	X	Y	Z	A B	R ⁸	熔点 ℃	异构体
II-20	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	油状	α : β 约 1:1
II-21	H	CH ₃	Cl	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	161	α : β 约 1:1
II-22	CH ₃	CH ₃	H	Br	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	177	α : β 约 1:1
II-23	Cl	OCH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	162	α : β 约 1:1
II-24	CH ₃	OCH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	170	α : β 约 1:1
II-25	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	166	α : β 约 1:1
II-26	CH ₃	Cl	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	156-158	混合物
II-27	H	C ₂ H ₅	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	98-100	混合物
II-28	C ₂ H ₅		CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	154-156	混合物
II-29	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	131-135	混合物
II-30	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	136-138	混合物
II-31	CH ₃	C ₂ H ₅	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	160-162	混合物

[0800] 实施例 I-2-a-1

[0801]



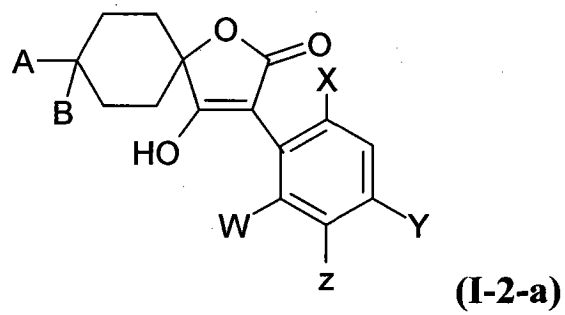
[0802] 将 280mg (0.72mmol) 实施例 III-1 的化合物溶于 5ml DMF 中, 添加 121mg (1.08mmol) 叔丁醇钾, 并将该混合物在室温搅拌 8h。该混合物用旋转蒸发仪浓缩, 剩余物在水和 MTB 醚之间分配, 水相用盐酸酸化, 并将产物用二氯甲烷萃取。将有机相干燥并浓缩。

[0803] 产量: 250mg (定量) 约 1 : 1 的顺 / 反异构体混合物

[0804] NMR (400MHz CDCl₃) : δ = 1.5-2.4 (m, 12H), 2.2 (s, 6H), 2.3 (s, 3H), 3.85 (m, 2H), 6.9 (s, 2H) ppm。

[0805] 以类似于实施例 (I-2-a-1) 的方式并根据制备方法的总的说明, 获得以下式 (I-2-a) 化合物。对异构体进行分离

[0806]



[0807]

实施例序号	W	X	Y	Z	A B	logP *	异构体
I-2-a-2	H	CH ₃	H	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ ⁻	2.73	α
I-2-a-3	H	CH ₃	H	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ ⁻	2.29	β
I-2-a-4	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ ⁻	2.52	β
I-2-a-5	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ ⁻	3.00	α
I-2-a-6	CH ₃	C ₂ H ₅	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ ⁻	3.44	α
I-2-a-7	CH ₃	C ₂ H ₅	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ ⁻	2.94	β
I-2-a-8	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ ⁻	3.09	β
I-2-a-9	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ ⁻	3.62	α
I-2-a-10	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ ⁻	2.28	β
I-2-a-11	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ ⁻	2.66	α
I-2-a-12	H	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	-O-(CH ₂) ₃ ⁻	3.74	β
I-2-a-13	H	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	-O-(CH ₂) ₃ ⁻	4.24	α
I-2-a-14	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ ⁻	2.73	β
I-2-a-15	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ ⁻	3.21	α

I-2-a-16	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.99	β
I-2-a-17	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	3.47	α
I-2-a-18	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.52	β
I-2-a-19	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	4.06	α
I-2-a-20	H	Cl	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.25	β
I-2-a-21	H	Cl	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.79	α
I-2-a-22	H	CH ₃	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.0	β
I-2-a-23	H	CH ₃	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.5	α
I-2-a-24	H	CH ₃	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.32	β
I-2-a-25	H	CH ₃	H	4-Cl-Pb	-O-(CH ₂) ₃ -	3.87	α
I-2-a-26	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	4.15	α

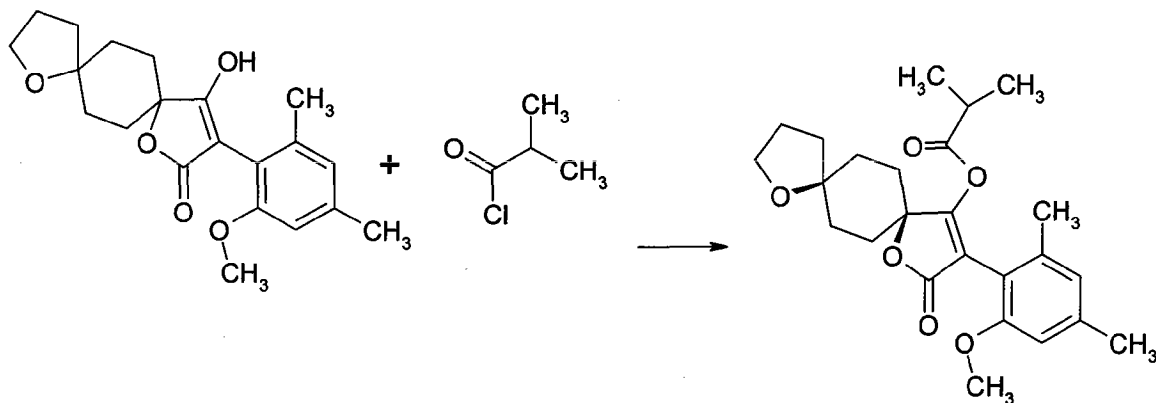
[0808]

实施例序号	W	X	Y	Z	A B	logP *	异构体
I-2-a-27	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.60	β
I-2-a-28	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.73	α
I-2-a-29	C ₂ H ₅	CH ₃	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	3.22	α
I-2-a-30	H	CH ₃	Br	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	3.28	α
I-2-a-31	H	CH ₃	Br	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	2.77	β
I-2-a-32	CH ₃	Br	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.48	β
I-2-a-33	CH ₃	Br	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.95	α
I-2-a-34	CH ₃	OCH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.05	β
I-2-a-35	CH ₃	OCH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.42	α
I-2-a-36	C ₂ H ₅	Cl	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.77	β
I-2-a-37	C ₂ H ₅	Cl	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	3.40	α
I-2-a-38	Cl	Br	C ₂ H ₅	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.79	β
I-2-a-39	Cl	Br	C ₂ H ₅	H	-O-(CH ₂) ₃ -	3.26	α
I-2-a-40	H	Cl	Cl	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	2.60	β
I-2-a-41	H	Cl	Cl	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	3.14	α
I-2-a-42	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.79	β
I-2-a-43	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	4.32	α
I-2-a-44	CH ₃	C ₂ H ₅	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.82	β
I-2-a-45	CH ₃	C ₂ H ₅	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	3.34	α
I-2-a-46	CH ₃	CH ₃	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.69	α
I-2-a-47	CH ₃	CH ₃	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.20	β
I-2-a-48	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	2.99	α

I-2-a-49	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	2.54	β
I-2-a-50	H	Cl	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	2.91	β
I-2-a-51	H	Cl	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.42	α

[0809] 实施例 I-2-b-1

[0810]



I-2-b-1

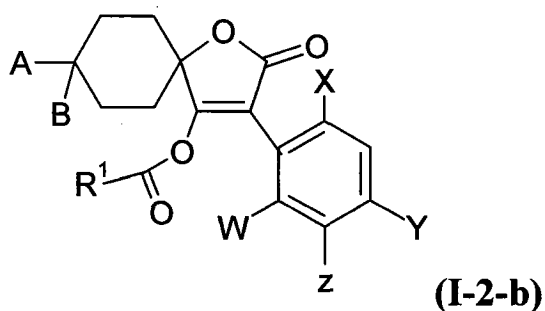
[0811] 将 204mg (0.569)mmol 化合物 (I-2-a-10) 和 (I-2-a-11) 的顺/反混合物溶于 10ml 二氯甲烷中, 添加 69mg (0.683mmol) 三乙胺, 并在室温逐滴添加 73mg (0.683mmol) 异丁酰氯。在室温搅拌 16h 后, 将该混合物浓缩并通过色谱法在硅胶上 (二氯甲烷/丙酮 100 : 10) 纯化。

[0812] 产量 : 51mg 顺式异构体 (I-2-b-1) (理论值的 21%)

[0813] log P : 4.12

[0814] 以类似于实施例 (I-2-b-1) 的方式并根据制备方法的总的说明, 获得以下式 (I-2-b) 化合物 :

[0815]



[0816]

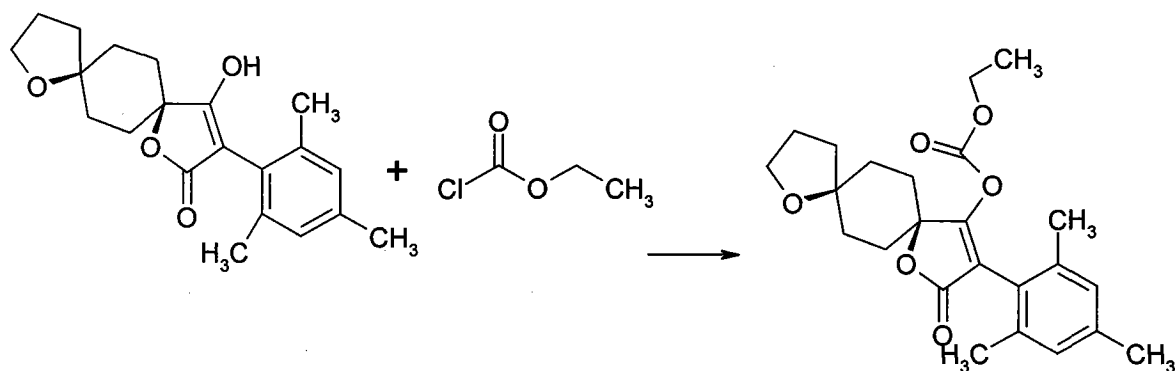
实施例 序号	W	X	Y	Z	A B	R ¹	logP *	异构体
I-2-b-2	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	4.60	α
I-2-b-3	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	5.64	β
I-2-b-4	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	6.24	α
I-2-b-5	H	CH ₃	H	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	4.22	β
I-2-b-6	H	CH ₃	H	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	4.78	α
I-2-b-7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	4.52	β
I-2-b-8	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	5.12	α
I-2-b-9	H	CH ₃	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	4.83	β

[0817]

实施例 序号	W	X	Y	Z	A B	R ¹	logP *	异构体
I-2-b-10	H	CH ₃	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	5.38	α
I-2-b-11	H	CH ₃	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	5.86	α
I-2-b-12	H	Cl	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	5.26	β
I-2-b-13	H	CH ₃	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	5.29	β
I-2-b-14	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	t-C ₄ H ₉	4.96	β
I-2-b-15	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₉	5.63	β
I-2-b-16	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	t-C ₄ H ₉	6.09	β
I-2-b-17	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	t-C ₄ H ₉	5.58	α
I-2-b-18	CH ₃	OCH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	3.75	β
I-2-b-19	CH ₃	OCH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	t-C ₄ H ₉	4.16	β
I-2-b-20	CH ₃	OCH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	4.25	α
I-2-b-21	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	t-C ₄ H ₉	4.50	β
I-2-b-22	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	5.17	β
I-2-b-23	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	t-C ₄ H ₉	5.62	β
I-2-b-24	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	5.79	α
I-2-b-25	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	t-C ₄ H ₉	6.25	α

[0818] 实施例 I-2-c-1

[0819]



I-2-c-1

[0820] 将 100mg(0.292mmol) 实施例 (I-2-a-4) 的化合物溶于 5ml 二氯甲烷中, 添加 35mg(0.350mmol) 三乙胺, 并在室温逐滴添加 38mg(0.350mmol) 氯甲酸乙酯。在室温搅拌

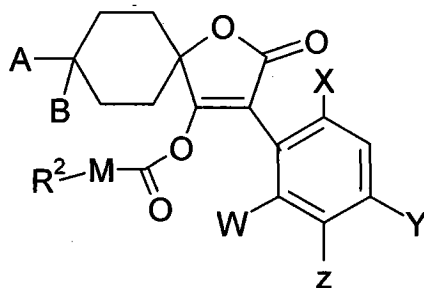
16h 后,将该混合物浓缩并通过制备型 HPLC 在 RP-18 硅胶上(乙腈/水)纯化。

[0821] 产量:64mg(I-2-c-1)(理论值的 53%)

[0822] log P:4.09

[0823] 以类似于实施例(I-2-c-1)的方式并根据制备方法的总的说明,获得以下式(I-2-c)化合物:

[0824]



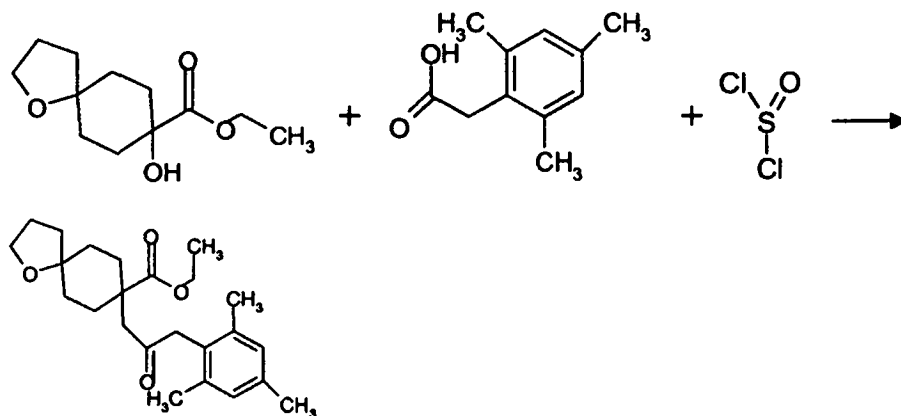
(I-2-c)

[0825]

实施例 序号	W	X	Y	Z	A B	M	R ²	log P *	异构 体
I-2-c-2	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	0	C ₂ H ₅	4.69	α
I-2-c-3	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	0	C ₂ H ₅	4.68	β
I-2-c-4	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	0	C ₂ H ₅	5.28	α

[0826] 实施例 III-1

[0827]



III-1

[0828] 首先将 178mg (1.0mmol) 2,4,6-三甲基苯基乙酸加入 10ml 甲苯中, 添加 238mg (2.0mmol) 亚硫酸氯和 1 滴 DMF, 将该混合物在 90℃ 搅拌 1h、冷却并使用旋转蒸发仪浓缩, 将剩余物溶于 5ml 甲苯中, 添加 228mg (1.0mmol) 实施例 XXII-1 的羟基酯, 并将该混合物在 90℃ 搅拌 8h、冷却并使用旋转蒸发仪浓缩。粗产物通过在 5% 浓度的氢氧化钠水溶液和 MTB 醚之间分配而纯化。将有机相干燥并浓缩。

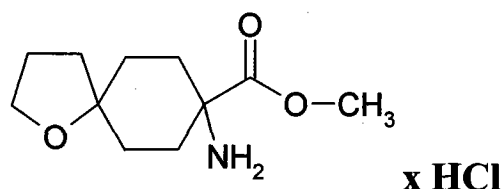
[0829] 产量: 280mg 油状物 (理论值的 72%)

[0830] DMF = N, N-二甲基甲酰胺

[0831] 所述油状物无需进一步纯化而用于合成实施例 I-2-a-1。

[0832] 实施例 XVI-1

[0833]



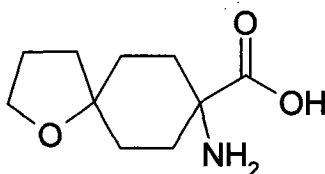
[0834] 在氩气下, 首先将 35g 实施例 XIX-1 的化合物于 0-5℃ 加入 880ml 甲醇中。逐滴添加 15.2ml 亚硫酸氯, 并将该混合物在 0℃ 搅拌 30 分钟并在 40℃ 搅拌 8h 直至形成澄清溶液。然后将该溶液冷却至 5℃, 并抽吸过滤沉淀物。使用旋转蒸发仪浓缩该溶液。

[0835] 产量: 31g (理论值的 84%)

[0836] $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, d_6 -DMSO): δ = 1.52-1.68 (m, 5H, $\underline{\text{CH}_2}$), 1.81-2.00 (m, 6H, $\underline{\text{CH}_2}$), 2.07-2.14 (m, 1H, $\underline{\text{CH}_2}$), 3.68-3.72 (m, 2H, $\underline{\text{OCH}_2}$), 3.74 (s, 3H, $\underline{\text{OCH}_3}$) ppm。

[0837] 实施例 XIX-1

[0838]

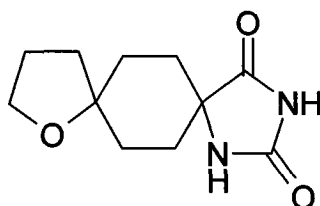


[0839] 在氩气下, 将 33.3g 实施例 XXIII-1 的化合物悬浮于 167ml 30% 浓度的 KOH 中, 并将该混合物在回流状态下搅拌过夜。

[0840] 使用旋转蒸发仪将该混合物浓缩至其体积的约 25%；在 0-10℃，使用浓 HCl 将 pH 调至 2。将该溶液用旋转蒸发仪浓缩并干燥。剩余物直接用于酯化，从而得到 XVI-1。

[0841] 实施例 XXIII-1

[0842]

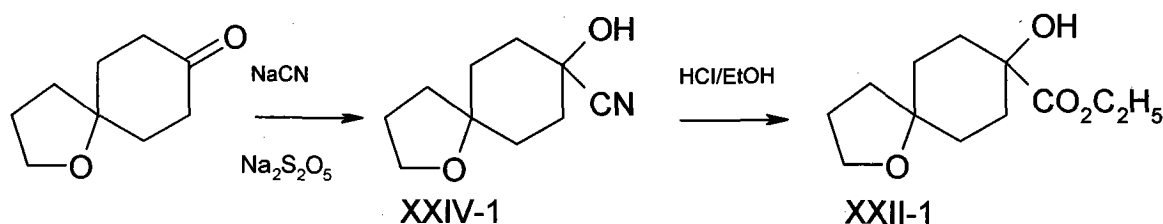


[0843] 首先将碳酸铵 (65g) 和氰化钠 (8.7g) 加入 290ml 水中。在室温下开始，逐滴添加 25g 1-氧杂螺-[4,5]-癸-8-酮 (已知于 DE 3241933A1、US 4438130A、WO 92/06094、WO 94/11374)，并将该反应混合物在 55℃-60℃ 搅拌 4 小时，浓缩至 50ml，然后在 0℃-5℃ 搅拌 2 小时，并在约 -2℃ 抽吸过滤，剩余物用少量冰水洗涤，并干燥。

[0844] 产量: 33.3g (理论值的 91%)，¹H-NMR (400MHz, d₆-DMSO) : δ = 1.36-1.39 (dm, 1H, CH₂), 1.58-1.72 (m, 8H, CH₂), 1.81-1.87 (m, 2H, CH₂), 1.88-2.02 (m, 1H, CH₂), 3.69-3.72 (t, 2H, OCH₂), 8.04, 8.19 (2s, 1H, NH-C), 10.31 (s, 1H, CO-NH-CO) ppm。

[0845] 8-羟基-1-氧杂螺[4,5]癸-8-羧酸乙酯 (XXII-1) 的合成

[0846]



[0847] 实施例 XXIV-1

[0848] 将 35g (713mmol) 氰化钠溶于 400ml 水中，在 20-28℃、于 30min 的时间内逐滴添加 100g (648mmol) 1-氧杂螺-[4,5]-癸-8-酮，接着添加 80g Na₂S₂O₅ (421mmol) 的溶液，并将该混合物在室温搅拌过夜。

[0849] 对于后处理，将该混合物萃取 3 次，每次用 300ml 甲苯，并将有机相使用旋转蒸发仪浓缩。

[0850] 产量: 107g 羟腈 (理论值的 91%) (XXIV-1)

[0851] 实施例 XXII-1

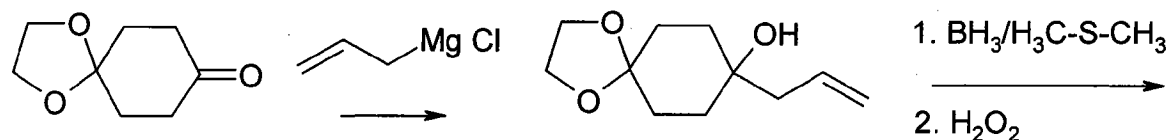
[0852] 将来自步骤 1 的 107g (236mmol) 羟腈 (XXIV) 溶于 400ml 乙醇中，并在 -20℃、于 5 小时内 (混合物缓慢温热至 -5℃) 引入氯化氢，并将该混合物在室温搅拌过夜。

[0853] 对于后处理，将溶剂在至多 45℃ 减压蒸馏掉，添加 400ml 冰水，并将该混合物搅拌 3 小时。将该混合物萃取 3 次，每次用 300ml 二氯甲烷，并将有机相用碳酸氢钠溶液洗涤、使用旋转蒸发仪浓缩并在高真空下蒸馏 (在 0.08mbar 下沸点为 116℃)。

[0854] 产量: 55.7g 羟基酯 (理论值的 41%) (XXII-1)

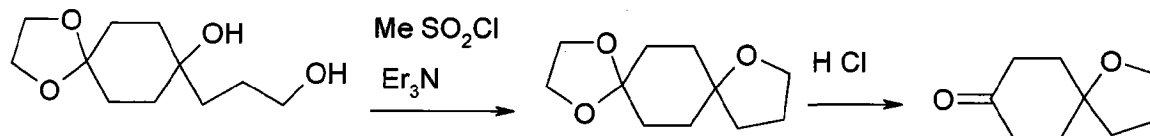
[0855] 1-氧杂螺-[4,5]-癸-8-酮 (E) 的制备

[0856]



A

B



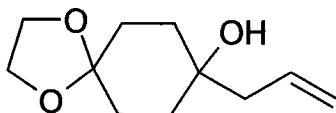
C

D

E

[0857] B 的制备：

[0858]

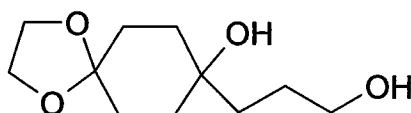


[0859] 在室温下, 首先加入 1.8ml (3.6mol) 烯丙基氯化镁 (2M, THF 中)。逐滴添加 467g (3mol) 1,4-环己烷二酮单亚乙基缩酮在 3000ml THF 中的溶液。添加之后, 将该反应混合物在回流状态下短暂加热, 然后冷却至 0℃。逐滴小心地添加约 300ml 水, 然后添加硅藻土, 并将该混合物搅拌 1 小时。然后将该反应混合物通过硅藻土在真空吸滤过滤器上过滤, 并将滤液使用旋转蒸发仪浓缩。为进行纯化, 将产物在油泵真空下并且在不冷却桥接器 (bridge) 的情况下进行蒸馏。头温度 (head temperature) 为 81-83℃。

[0860] 产量: 485g (= 理论值的 81%)

[0861] C 的制备：

[0862]

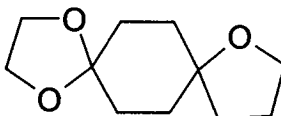


[0863] 在 0℃, 将 225.4g (2.94mol) 硼烷 / 甲硫醚复合物逐滴添加至 485.1g (2.45mol) 化合物 B 在 3675ml THF 中的溶液中。然后将该反应混合物在室温搅拌过夜。然后在 0℃, 将 1225ml 水、980ml 3M NaOH 和 980ml 过氧化氢 (30% 浓度的水溶液) 依次逐滴添加至所述反应混合物中。将水相用甲基叔丁基醚 (MTBE) 萃取三次, 并将合并的有机相用硫酸钠干燥。分离出该干燥剂, 然后除去溶剂, 产物可无需进一步纯化而进行反应。

[0864] 产量: 275g (= 理论值的 52%)

[0865] D 的制备：

[0866]

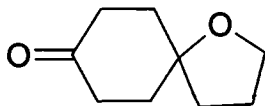


[0867] 在 0℃, 首先加入 274.3g (1.27mol) 化合物 C 和 294.6g (2.92mol) 三乙胺在 3175ml 二氯甲烷中的溶液。将 160g (1.4mol) 甲磺酰氯在 1270ml 二氯甲烷中的溶液逐滴缓慢添加至所述溶液中。添加结束后, 将该混合物搅拌过夜。将有机相用水洗涤一次, 用碳酸钾溶液洗涤一次并用稀 HCl 洗涤一次, 然后用硫酸钠干燥。分离出干燥剂, 然后除去溶剂, 并为进行纯化将该产物在油泵真空下于 68-72℃ 的头温度下进行蒸馏。

[0868] 产量: 101g (= 理论值的 40%)

[0869] E 的制备:

[0870]



[0871] 在 80℃, 将 101g (0.51mol) 化合物 D 在 408ml THF 中的溶液在 428ml 稀 HCl (326ml 水和 102ml 浓 HCl) 中搅拌过夜。监测反应的进展, 一旦检测不到原料即蒸馏掉反应混合物中的溶剂, 然后将混合物用氯仿萃取三次。合并的有机相用硫酸钠干燥。分离出该干燥剂, 然后除去溶剂, 为进行纯化将产物在油泵真空下、于 56-58℃ 的头温度下进行蒸馏。

[0872] 产量: 56g (= 理论值的 71%)

[0873] logP 值的测定

[0874] 表中给出的 logP 值根据 EEC Directive 79/831 Annex V. A8 通过 HPLC (高效液相色谱法) 在反相柱 (C18) 上测定。温度: 55℃。

[0875] 用于在酸性范围 (pH 3.4) 内进行测定的流动相:

[0876] 流动相 A: 乙腈 +1ml 甲酸 / 升。流动相 B: 水 +0.9ml 甲酸 / 升。

[0877] 梯度: 在 4.25min 内, 从 10% 流动相 A / 90% 流动相 B 至 95% 流动相 A / 5% 流动相 B。

[0878] 使用具有已知 logP 值的无支链的烷-2-酮 (具有 3-16 个碳原子) 进行校正 (通过两种连续烷酮之间的线性内插由保留时间确定 logP 值)。λ 的最大值在使用 200nm-400nm 的 UV 光谱的色谱信号最大值中确定。

[0879] 用途实施例

[0880] 实施例 1

[0881] 1. 出苗前除草作用

[0882] 将单子叶和双子叶杂草及作物植物的种子放入木纤维盆中的砂壤土中并用土覆盖。然后将以可湿性粉剂 (WP) 或乳油 (EC) 形式配制的供试化合物作为含水悬浮剂或乳剂以多种剂量施用于覆盖土壤的表面, 其中水施用率为 600l/ha (经换算后) 并添加有 0.2% 润湿剂。处理后, 将该盆置于温室中并使之保持在对供试植物而言良好的生长条件下。在 3 周试验期之后, 通过与未处理的对照植株进行比较目测评估对供试植株的损害 (以百分比 (%) 计的除草活性: 100% 活性 = 植株死亡, 0% 活性 = 与对照植株相同)。

[0883] 通过出苗前方法以 320g/ha 的活性成分进行施用, 以下化合物对稗草 (Echinochloa crus-galli)、多花黑麦草 (Lolium multiflorum) 和狗尾草 (Setaria viridis) 表现出 ≥ 80% 的活性: 实施例 I-1-a-2, I-1-a-4, I-1-a-8, I-1-a-10, I-1-a-11, I-1-a-12, I-1-a-13, I-1-a-40, I-1-a-49, I-1-a-51, I-1-a-54, I-1-a-55, I-1-b-1,

I-1-b-5, I-1-b-7, I-2-b-1, I-2-b-2, I-1-c-1, I-1-c-11, I-1-c-12, I-1-c-13, I-1-c-15, I-1-c-16, I-1-c-18, I-1-c-19

[0884] 2. 出苗后除草作用

[0885] 将单子叶和双子叶杂草及作物植物的种子放入木纤维盆中的砂壤土中,用土壤覆盖并在温室中于良好的生长条件下培育。播种后两至三周,将供试植株在一叶期进行处理。然后将以可湿性粉剂(WP)或乳油(EC)形式配制的供试化合物以多种剂量喷雾至植株的绿色部位上,其中水施用率为600l/ha(经换算后)并添加有0.2%润湿剂。将供试植株在温室中于最适宜的生长条件下保持约3周后,与未处理的对照组比较,目测评估制剂的活性(以百分比(%)计的除草活性:100%活性=植株死亡,0%活性=与对照植株相同)。

[0886] 通过出苗后方法以80g/ha的活性成分进行施用,以下化合物对大穗看麦娘(*Alopecurus myosuroides*)、稗草、多花黑麦草和狗尾草表现出 $\geq 80\%$ 的活性:实施例I-1-a-10, I-1-a-11, I-1-a-12, I-1-a-49, I-1-a-51

[0887] 通过出苗后方法以80g/ha的活性成分进行施用,以下化合物对大穗看麦娘、稗草、多花黑麦草和狗尾草表现出 $\geq \%$ 的活性:I-1-a-4, I-1-a-54, I-1-a-58, I-1-c-10, I-1-c-11, I-1-c-12, I-1-c-13, I-1-c-14

[0888] 实施例2

[0889] 1. 出苗后除草作用

[0890] 将单子叶和双子叶杂草及作物植物的种子放入木纤维盆或塑料盆中的砂壤土中,用土覆盖并在温室中于良好生长条件下培育,在营养生长期期间也在温室外进行户外培育。播种后2至3周,将供试植株在一叶至三叶期进行处理。将以可润湿粉剂(WP)或液剂(EC)形式配制的供试化合物以多种剂量喷雾至植株上和土壤表面,其中水施用率为300l/ha(经换算的)并且添加有润湿剂(0.2-0.3%)。对供试植株处理之后3至4周,与未经处理的对照植株比较,目测评价制剂的药效(以百分比计的除草活性:100%活性=植物死亡,0%活性=与对照植株相同)。

[0891] 安全剂的使用

[0892] 如果另外测试安全剂是否可改进供试物质对作物植物的植物相容性,则使用以下方式来施用安全剂:

[0893] - 将作物植物的种子在播种之前用安全剂物质进行拌种(安全剂的量基于种子的重量以百分比表述)

[0894] - 在施用供试物质之前,将安全剂以每公顷一定的施用率喷雾作物植物(通常在施用供试物质之前1天)

[0895] - 将安全剂与供试物质以桶混物的形式一起施用(安全剂的量以g/ha或以基于除草剂的比例表述)。

[0896] 温室内谷物容器试验

[0897] 在施用除草剂之前1天施用吡咯二酸(mefenpyr)

[0898]

	施用率 g 活性成分/ha	施用后 28 天 夏季小麦 观测值(%)
实施例 I-1-a-11	100	95
	50	80
	25	70
	12.5	65
实施例 I-1-a-11 + 吡咯二酸	100 + 50	80
	50 + 50	40
	25 + 50	30
	12.5 + 50	10

[0899]

	施用率 g 活性成分/ha	施用后 10 天 夏季大麦 观测值(%)
实施例 I-1-a-13	50	30
	25	20
	12.5	20
实施例 I-1-a-13 + 吡咯二酸	50 + 50	10
	25 + 50	2
	12.5 + 50	0

[0900]

	施用率 g 活性成分/ha	施用后 28 天 夏季小麦 观测值(%)
实施例 I-1-a-13	100	50
	50	30
	25	10
实施例 I-1-a-13 + 吡咯二酸	100 + 50	30
	50 + 50	10
	25 + 50	5

[0901]

	施用率 g 活性成分/ha	施用后 28 天 夏季小麦 观测值(%)
实施例 I-1-b-7	100	60
	50	50
	25	10
实施例 I-1-b-7 + 吡咯二酸	100 + 50	5
	50 + 50	5
	25 + 50	2

[0902] 实施例 3

[0903] 猿叶甲 (Phaedon) 试验 (PHAECO 喷雾处理)

[0904] 溶剂:78.0 重量份丙酮

[0905] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0906] 乳化剂:0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0907] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将该浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。

[0908] 将甘蓝 (*Brassica pekinensis*) 的圆叶片用所需浓度的活性化合物制剂进行喷雾,并在变干之后,接种辣根猿叶虫 (*Phaedon cochleariae*) 的幼虫。

[0909] 经所需时间段之后,确定以%计的效果。100%意指所有的甲虫幼虫被杀死,0%意指没有甲虫幼虫被杀死。

[0910] 本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在 500g/ha 的施用率时表现出 $\geq 80\%$ 的药效:

[0911] 实施例序号 I-1-a-3, I-1-a-4, I-1-a-5, I-1-a-6, I-1-a-13, I-1-a-18, I-1-a-23, I-1-a-41, I-1-a-43, I-1-a-44, I-1-a-45, I-1-a-46, I-1-a-48, I-1-a-49, I-1-a-51, I-1-a-54, I-1-a-56, I-1-a-58, I-1-b-1, I-1-b-7, I-1-c-1, I-1-c-12, I-1-c-15, I-1-c-21, I-2-a-3, I-2-a-4, I-2-a-14, I-2-a-18, I-2-a-21, I-2-a-22, I-2-a-23, I-2-a-24, I-2-a-25, I-2-a-32, I-2-a-42, I-2-a-44, I-2-a-47, I-2-a-49, I-2-b-1, I-2-b-5, I-2-b-7, I-2-b-15, I-2-b-21, I-2-c-1, I-2-c-2

[0912] 实施例 4

[0913] 草地贪夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*) 试验 (喷雾处理)

[0914] 溶剂:78.0 重量份丙酮

[0915] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0916] 乳化剂:0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0917] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将该浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。

[0918] 将玉米 (*Zea mays*) 的圆叶片用所需浓度的活性化合物制剂进行喷雾,并在变干之后,接种草地贪夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*) 的幼虫。

[0919] 经所需时间段之后,确定以%计的效果。100%意指所有的幼虫被杀死,0%意指没有幼虫被杀死。

[0920] 本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在 500g/ha 的施用率时表现出 $\geq 80\%$ 的活性:

[0921] 实施例序号 I-1-a-1, I-1-a-2, I-1-a-3, I-1-a-4, I-1-a-34, I-1-a-36, I-1-a-43, I-1-a-58, I-1-b-7, I-1-c-1, I-1-c-2, I-1-c-3, I-1-c-4, I-2-a-4, I-2-a-18, I-2-a-32, I-2-b-15, I-2-b-16

[0922] 实施例 5

[0923] 叶螨属 (*Tetranychus*) 试验, OP 抗性 (TETRUR 喷雾处理)

[0924] 溶剂:78 重量份丙酮

[0925] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0926] 乳化剂:0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0927] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂

混合,并将该浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。

[0928] 将被所有阶段的二斑叶螨 (*Tetranychus urticae*) 侵扰的菜豆 (*Phaseolus vulgaris*) 的圆叶片用所需浓度的活性化合物制剂进行喷雾。

[0929] 经所需时间段之后,确定以%计的效果。100%意指所有的叶螨被杀死;0%意指没有叶螨被杀死。

[0930] 本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在 100g/ha 的施用率时表现出 $\geq 80\%$ 的药效:

[0931] 实施例序号 I-1-a-1, I-1-a-2, I-1-a-3, I-1-a-4, I-1-a-11, I-1-a-13, I-1-a-20, I-1-a-27, I-1-a-40, I-1-a-41, I-1-a-44, I-1-a-46, I-1-b-1, I-1-b-3, I-1-b-6, I-1-b-7, I-1-c-2, I-1-c-21, I-2-a-1, I-2-a-4, I-2-a-5, I-2-a-6, I-2-a-10, I-2-a-12, I-2-a-16, I-2-a-18, I-2-a-20, I-2-a-21, I-2-a-23, I-2-a-24, I-2-a-25, I-2-a-26, I-2-a-42, I-2-a-43, I-2-a-47, I-2-a-51, I-2-b-2, I-2-b-5, I-2-b-7, I-2-b-8, I-2-b-11, I-2-b-14, I-2-b-15, I-2-b-16, I-2-b-22, I-2-b-23, I-2-b-24, I-2-b-25, I-2-c-1, I-2-c-2, I-2-c-3, I-2-c-4

[0932] 本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在 500g/ha 的施用率时表现出 $\geq 80\%$ 的药效:

[0933] 实施例序号 I-1-a-9, I-1-a-10, I-1-c-2, I-1-c-3, I-1-c-4, I-2-a-50

[0934] 实施例 6

[0935] 桃蚜 (*Myzus*) 试验 (MYZUPE 喷雾处理)

[0936] 溶剂:78 重量份丙酮

[0937] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0938] 乳化剂:0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0939] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将该浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。

[0940] 将被所有阶段的桃蚜 (*Myzus persicae*) 侵扰的甘蓝 (*Brassica pekinensis*) 的圆叶片用所需浓度的活性化合物制剂进行喷雾。

[0941] 经所需时间段之后,确定以%计的效果。100%意指所有的蚜虫被杀死;0%意指没有蚜虫被杀死。

[0942] 本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在 500g/ha 的施用率时表现出 $\geq 80\%$ 的药效:

[0943] 实施例序号 I-1-a-1, I-1-a-2, I-1-a-3, I-1-a-4, I-1-a-5, I-1-a-6, I-1-a-7, I-1-a-8, I-1-a-9, I-1-a-10, I-1-a-11, I-1-a-12, I-1-a-13, I-1-a-14, I-1-a-15, I-1-a-16, I-1-a-17, I-1-a-18, I-1-a-19, I-1-a-20, I-1-a-21, I-1-a-22, I-1-a-23, I-1-a-24, I-1-a-25, I-1-a-26, I-1-a-27, I-1-a-28, I-1-a-29, I-1-a-31, I-1-a-32, I-1-a-33, I-1-a-34, I-1-a-35, I-1-a-36, I-1-a-37, I-1-a-38, I-1-a-39, I-1-a-40, I-1-a-41, I-1-a-42, I-1-a-43, I-1-a-44, I-1-a-45, I-1-a-46, I-1-a-47, I-1-a-48, I-1-a-49, I-1-a-50, I-1-a-51, I-1-a-52, I-1-a-54, I-1-a-55, I-1-a-56, I-1-a-57, I-1-a-58, I-1-b-1, I-1-b-2, I-1-b-3, I-1-b-4, I-1-b-5, I-1-b-6, I-1-b-7, I-1-c-1, I-1-c-2, I-1-c-3, I-1-c-4, I-1-c-5, I-1-c-6, I-1-c-7, I-1-c-8,

I-1-c-9, I-1-c-10, I-1-c-11, I-1-c-12, I-1-c-13, I-1-c-14, I-1-c-15, I-1-c-16, I-1-c-18, I-1-c-21, I-1-b-2, I-2-a-1, I-2-a-2, I-2-a-3, I-2-a-4, I-2-a-5, I-2-a-6, I-2-a-7, I-2-a-8, I-2-a-10, I-2-a-11, I-2-a-12, I-2-a-13, I-2-a-14, I-2-a-15, I-2-a-16, I-2-a-17, I-2-a-18, I-2-a-19, I-2-a-20, I-2-a-21, I-2-a-22, I-2-a-23, I-2-a-24, I-2-a-25, I-2-a-26, I-2-a-27, I-2-a-28, I-2-a-29, I-2-a-30, I-2-a-31, I-2-a-32, I-2-a-33, I-2-a-34, I-2-a-35, I-2-a-36, I-2-a-38, I-2-a-39, I-2-a-40, I-2-a-41, I-2-a-42, I-2-a-43, I-2-a-44, I-2-a-45, I-2-a-46, I-2-a-47, I-2-a-48, I-2-a-49, I-2-a-50, I-2-a-51, I-2-b-1, I-2-b-2, I-2-b-5, I-2-b-6, I-2-b-7, I-2-b-8, I-2-b-9, I-2-b-10, I-2-b-12, I-2-b-13, I-2-b-14, I-2-b-15, I-2-b-16, I-2-b-17, I-2-b-18, I-2-b-19, I-2-b-22, I-2-b-23, I-2-b-24, I-2-c-1, I-2-c-2, I-2-c-3, I-2-c-4

[0944] 实施例 7

[0945] 根结线虫 (*Meloidogyne*) 试验 (MELGIN 喷雾处理)

[0946] 溶剂:80 重量份丙酮

[0947] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合,并将该浓液用水稀释至所需浓度。

[0948] 将沙、活性化合物溶液、南方根结线虫 (*Meloidogyne incognita*) 的卵幼虫悬浮液和莴苣种子装入容器。莴苣种子萌芽并且植株发育。在根部,形成虫瘿。

[0949] 经所需时间段之后,通过虫瘿的形成确定以%计的杀线虫活性。100%意指没有发现虫瘿;0%意指经处理植株上的虫瘿数目相当于未处理对照组上的虫瘿数目。

[0950] 本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在 500g/ha 的施用率下表现出 $\geq 80\%$ 的药效:

[0951] 实施例序号 I-2-a-4, I-2-a-5, I-2-b-9, I-2-a-11

[0952] 实施例 8

[0953] 微小牛蜱 (*Boophilus microplus*) 试验 (BOOPMI 注射)

[0954] 溶剂:二甲亚砜

[0955] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合,并将该浓液用水稀释至所需浓度。

[0956] 将活性化合物溶液注射到微小牛蜱 (*Boophilus microplus*) 腹部中,将该动物转移到器皿中并贮存在气候实验室中。通过检查受精卵的产卵情况来确定活性。

[0957] 经所需时间段之后,确定以%计的活性。100%意指没有蜱虫产受精卵。

[0958] 本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在 20 μ g/ 动物的施用率下表现出 $\geq 80\%$ 的药效:

[0959] 实施例序号 I-1-a-3, I-1-a-4, I-1-a-5, I-1-a-6, I-1-b-1, I-2-a-1

[0960] 实施例 9

[0961] 铜绿蝇 (*Lucilia cuprina*) 试验 (LUCICU)

[0962] 溶剂:二甲亚砜

[0963] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合,并将该浓液用水稀释至所需浓度。

[0964] 将铜绿蝇 (*Lucilia cuprina*) 幼虫放入包含经所需浓度的活性化合物制剂处理过

的马肉的容器中。

[0965] 经所需时间段之后,确定以%计的死亡率。100%意指所有的幼虫被杀死;0%意指没有幼虫被杀死。

[0966] 本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在 100ppm 的施用率下表现出 $\geq 80\%$ 的药效:

[0967] 实施例序号 I-1-a-3, I-1-a-4, I-1-a-5, I-1-a-6, I-1-a-7, I-1-a-8, I-1-b-1, I-1-c-2, I-1-c-3, I-1-c-4, I-2-a-1

[0968] 实施例 10

[0969] 桃蚜 (*Myzus persicae*) 试验 (MYZUPE)

[0970] 溶剂:7 重量份二甲基甲酰胺

[0971] 乳化剂:2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0972] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将该浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。为对铵盐、渗透剂、或铵盐和渗透剂进行所需施用,在对 1000ppm 浓度的各制剂的终溶液进行稀释后,将这些物质各自用移量管添加。

[0973] 将被桃蚜 (*Myzus persicae*) 严重侵扰的辣椒 (*Capsicum annuum*) 植株通过用所需浓度的活性化合物制剂进行喷雾来处理。

[0974] 经所需时间段之后,确定以%计的死亡率。100%意指所有该动物被杀死;0%意指没有该动物被杀死。

[0975] 本试验中,例如,以下制备实施例的化合物表现出良好的药效:见表

[0976]

通过添加 RME 和 RME + AMS 来提高活性			6 天后的%药效			
活性化合物		ppm	无添加剂	+ AMS	+ RME	+ RME + AMS
实施例 I-1-a-8	MYZUPE	4 0.8	45 0	98 0	99 20	100 99
实施例 I-1-a-4	MYZUPE	4 0.8	75 10	80 0	90 60	98 99

[0977] 实施例 11

[0978] 棉蚜 (*Aphis gossypii*) 试验 (APHIGO)

[0979] 溶剂:7 重量份二甲基甲酰胺

[0980] 乳化剂:2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0981] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将该浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。为对铵盐、渗透剂、或铵盐和渗透剂进行所需施用,在对 1000ppm 浓度的各制剂的终溶液进行稀释后,将这些物质各自用移量管添加。

[0982] 将被棉蚜 (*Aphis gossypii*) 严重侵扰的陆地棉 (*Gossypium hirsutum*) 叶用所需浓度的活性化合物制剂进行喷雾。

[0983] 经所需时间段之后,确定以%计的死亡率。100%意指所有蚜虫被杀死;0%意指没有蚜虫被杀死。

[0984] 本试验中,例如,以下制备实施例的化合物表现出良好的药效:见表

[0985]

通过添加 RME 和 RME + AMS 来提高活性			6 天后的%药效			
活性化合物		ppm	无添加剂	+ AMS	+ RME	+ RME + AMS
实施例 I-1-a-4	APHIGO	4 0.8	60 10	75 0	75 15	80 45
实施例 I-1-a-6	APHIGO	20	35	5	60	95

[0986] RME = 菜籽油甲基酯

[0987] AMS = 硫酸铵

[0988] 实施例 12

[0989] 烟芽夜蛾 (*Heliothis virescens*) 试验 -- 转基因植物的处理

[0990] 溶剂:7 重量份丙酮

[0991] 乳化剂:1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0992] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和所述量的乳化剂混合,并将该浓液用水稀释至所需浓度。

[0993] 将栽培种 Roundup Ready (Monsanto Comp. USA 的商标) 的大豆 (*Glycine max*) 的芽通过浸入所需浓度的活性化合物制剂中进行处理,并在叶仍湿润时接种烟芽夜蛾 (*Heliothis virescens*)。

[0994] 经所需时间段之后,确定昆虫的死亡率。

[0995] 实施例 13

[0996] 临界浓度试验 / 土壤昆虫 -- 转基因植物的处理

[0997] 供试昆虫: *Diabrotica balteata* 在土壤中的幼虫

[0998] 溶剂:7 重量份丙酮

[0999] 乳化剂:1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[1000] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合,添加所述量的乳化剂,并将该浓液用水稀释至所需浓度。

[1001] 将活性化合物制剂浇泼在土壤上。此处,制剂中活性化合物的浓度实质上并不重要;只有以 ppm(mg/l) 表示的每体积单位土壤中活性化合物重量的量才是重要的。将土装入 0.25l 的盆中,并使其静置于 20℃。

[1002] 制备之后,立即将 5 粒经催芽的栽培种 YIELD GUARD(MonsantoComp.,USA 的商标)的玉米粒放入每个盆中。2 天之后,将合适的供试昆虫放入经处理的土壤中。再过 7 天之后,通过对出苗的玉米植株计数确定活性化合物的药效(1 株植株= 20%活性)。