

[19]中华人民共和国国家知识产权局

[51]Int. Cl<sup>7</sup>

## [12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 00810818.8

[43]公开日 2002 年 8 月 14 日

C07D275/02  
C07D275/06 C07D309/14  
C07D327/04 C07D333/64  
C07D333/66 C07D513/10  
C07D497/10 C07C309/67  
C07C311/13 C07C317/44  
C07C317/32 C07C323/56  
[11]公开号 CN 1364162A

[22]申请日 2000.5.16 [21]申请号 00810818.8  
[30]优先权  
[32]1999.5.28 [33]DE [31]19924668.8  
[86]国际申请 PCT/EP00/04415 2000.5.16  
[87]国际公布 WO00/73289 德 2000.12.7  
[85]进入国家阶段日期 2002.1.24  
[71]申请人 拜尔公司  
地址 德国莱沃库森  
[72]发明人 R·菲舍尔 O·克雷特施克 T·申克  
R·-I·申克尔 J·维德曼  
C·埃尔德伦 P·勒泽尔  
M·W·德雷维斯 D·福伊希特  
W·安德施

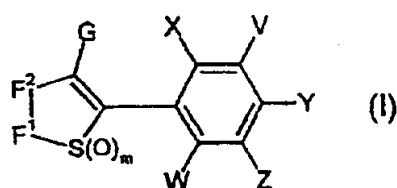
[74]专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司  
代理人 张元忠 谭明胜

权利要求书 33 页 说明书 132 页 附图页数 0 页

[54]发明名称  $\alpha$ -苯基- $\beta$ -酮基砜

[57]摘要

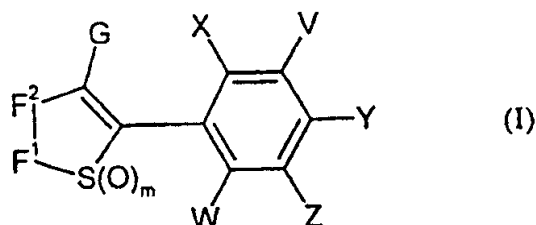
本发明涉及新的式(I)的芳基-取代的  $S(O)_m$  环  
其中  $F^1, F^2, G, V, W, X, Y, Z$  和  $m$  各自如说明书中所述  
定义。本发明还涉及所述环制备方法和它们在农业上  
的应用,例如用作作物保护剂(杀菌剂,除草剂和杀虫  
剂)。



ISSN 1008-4274

## 权 利 要 求 书

## 1. 式(I)化合物



5 其中

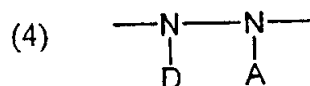
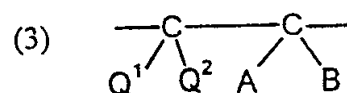
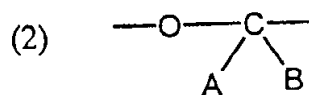
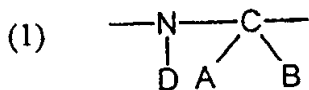
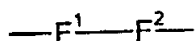
V, W, X, Y 和 Z 各自独立地代表氢、卤素、硝基、氰基或选自下列基团的基团: 烷基、链烯基、炔基、烷氧基、 $S(O)_n$ -烷基、卤代烷基、卤代烷氧基, 各自可任意选择地取代的芳基、苯基烷基、芳氧基、苯基-烷氧基或芳基- $S(O)_n$ -, 其中两个邻近基团与它们连接的碳原子一起形成可任意选择地取代的环, 该环可任意选择地由一个或多个杂原子间断;

条件是取代基 V, W, X, Y 或 Z 中至少一个基团必须不是氢,

n 代表 0-2 的数,

m 代表 1 和 2,

15  $F^1$  和  $F^2$  代表下列基团之一



其中

A 代表氢,各自可任意选择地被卤素取代的烷基、链烯基、烷氧基烷基、多烷氧基烷基、烷硫基烷基、饱和或不饱和的,可任意选择地取代的环烷基,其中可任意选择地至少一个环原子被杂原子替换,或代表各自可任意选择地被卤素-、烷基-、卤代烷基-、烷氧基-、卤代烷氧基-、氟基-或硝基-取代的芳基、芳烷基或杂芳基,

B 代表氢、烷基或烷氧基烷基,或

A 和 B 与它们所连接的碳原子一起代表饱和或不饱和的,未取代或取代的环,其中可任意选择地含有至少一个杂原子,

D 代表氢或可任意选择地取代的下列基团:烷基、烯基、炔基、烷氧基烷基、多烷氧基烷基、烷硫基烷基、饱和或不饱和的可任意选择地取代的环烷基,其中可任意选择地一个或多个环原子被杂原子替换,代表可任意选择地取代的芳烷基,芳基,杂芳基烷基,杂芳基或  $\text{CO-R}^{11}$ , 或

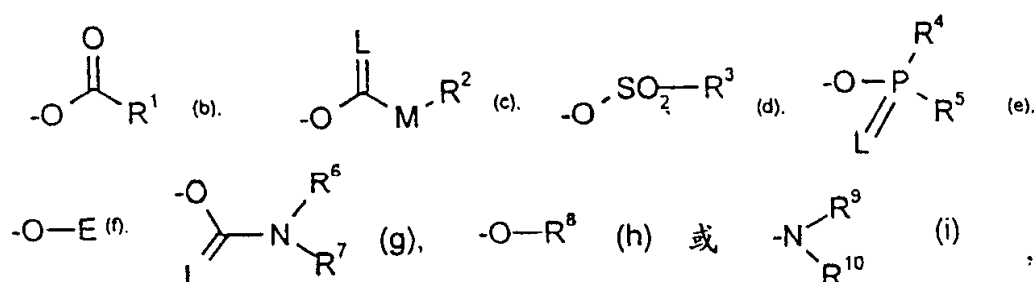
A 和 D 与它们所连接的原子一起代表饱和或不饱和环,其中在 A, D-部分是未取代或取代的以及可任意选择地含有至少一个(另外 -  $\text{F}^1\text{-F}^2 = (4)$ )杂原子, 或

A 和  $\text{Q}^1$  一起代表烷二基或烯二基,其中每个基团可任意选择地被各自可任意选择地取代的烷基、羟基、烷氧基、烷硫基、环烷基、苄氧基或芳基所取代,或代表可任意选择地取代的链烷双烯二基,条件是 B 和  $\text{Q}^2$  与它们所连接的碳原子一起代表双键以及取代基 W 或 X 中至少一个不代表氢,

$\text{Q}^1$  代表氢、烷基、烷氧基烷基、烷氧硫基烷基,饱和或不饱和,可任意选择地取代的环烷基,其中可任意选择地一个或多个环原子被杂原子替换,或代表可任意选择地取代的苯基,

$\text{Q}^2$  代表氢或烷基,

G 代表羟基(a)或代表下列基团之一:



其中

E 代表金属离子或铵离子,

L 代表氧或硫,

M 代表氧或硫,

5  $R^1$  代表各自可任意选择地被卤素取代的烷基、链烯基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、多烷氧基烷基或可任意选择地被卤素-、烷基-或烷氧基-取代的环烷基, 其中一个或多个亚甲基可被杂原子替换, 或代表各自可任意选择地取代的苯基、苯基烷基、杂芳基、苯氧基烷基或杂芳氧基烷基,

10  $R^2$  代表各自可任意选择地被卤素取代的烷基、链烯基、烷氧基烷基、多烷氧基烷基或代表各自可任意选择地取代的环烷基、苯基或苄基,

$R^3, R^4$  和  $R^5$  各自独立地代表各自可任意选择地被卤素取代的烷基、烷氧基、烷基氨基、二烷基氨基、烷硫基、链烯硫基、环烷硫基和代表各自可任意选择地取代的苯基、苄基、苯氧基或苯硫基以及

15  $R^6$  和  $R^7$  各自独立地代表氢, 各自可任意选择地被卤素取代的烷基、环烷基、链烯基、烷氧基、烷氧基烷基, 代表可任意选择地取代的苯基, 代表可任意选择地取代的苄基, 或与它们所连接的 N 原子一起代表可任意选择地取代的环, 其中环可任意选择地被氧或硫间断,

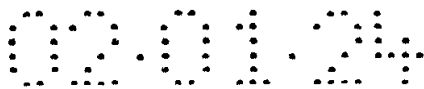
20  $R^8$  代表各自可任意选择地被卤素取代的烷基、烷氧基烷基、链烯基、链烯氧基烷基、炔基、炔氧基烷基、烷基羰基烷基、烷氧基羰基烷基或代表可任意选择地取代的环烷基或代表可任意选择地取代的芳烷基、芳基羰基烷基或苯氧基烷基,

25  $R^9$  和  $R^{10}$  各自独立地代表氢、烷基、链烯基、烷氧基烷基、烷硫基烷基, 代表环烷基, 它可任意选择地被杂原子所间断, 代表各自可任意选择地取代的苯基、苯基烷基、苯氧基烷基、杂芳基或杂芳基烷基, 或

$R^9$  和  $R^{10}$  与它们所连接的氮原子一起形成 3-至 9-元环, 其中可任意选择地取代以及可任意选择地被其它杂原子间断, 或

30  $R^{10}$  代表基团  $CO-R^{11}$ , 其中

$R^{11}$  代表氢, 可任意选择地被卤素取代的烷基、链烯基、烷氧基, 可任意选择地取代的环烷基, 它可任意选择地被杂原子间断, 或代表



可任意选择地取代的芳基、芳烷基、芳烷氧基或苯氧基,这里,可能的取代基是卤素、硝基、氰基、烷基、烷氧基、卤代烷基和卤代烷氧基。

2. 权利要求 1 的式(I)化合物,其中

5 V 代表氢、卤素、 $C_1-C_6$ -烷基、 $C_1-C_6$ -卤代烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基、 $C_1-C_6$ -卤代烷氧基、苯基、硝基或氰基,

W 代表氢、卤素、 $C_1-C_6$ -烷基、 $C_1-C_6$ -卤代烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基、 $C_1-C_6$ -卤代烷氧基、硝基或氰基,

10 X 代表氢、卤素、 $C_1-C_6$ -烷基、 $C_1-C_6$ -卤代烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基、 $C_2-C_6$ -链烯基、 $C_2-C_6$ -炔基、 $C_1-C_6$ -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、硝基、氰基或各自可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -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-、硝基-或氰基-取代的苯基、苯基- $C_1-C_4$ -烷基、苯氧基、苯硫基、苄氧基或苄硫基,

15 Y 和 Z 各自独立地代表氢、卤素、 $C_1-C_6$ -烷基、 $C_1-C_6$ -卤代烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基、 $C_2-C_6$ -链烯基、 $C_2-C_6$ -炔基、 $C_1-C_6$ -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、硝基、氰基或各自可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -烷基-、 $C_1-C_6$ -烷氧基、 $C_1-C_4$ -卤代烷基-、 $C_1-C_6$ -卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的苯基、苯基- $C_1-C_4$ -烷基、苯氧基、苯硫基、苄氧基或苄硫基,

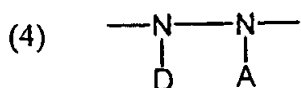
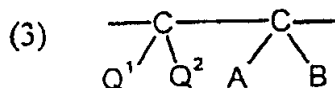
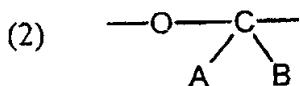
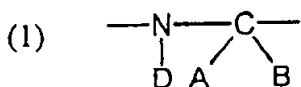
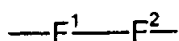
20 X 和 V 与它们所连接的碳原子一起代表可任意选择地被卤素-或烷基-取代的 5-或 6-元环,该环可任意选择地被一个或两个杂原子间断,条件是 Y 和 Z 不形成环,

Y 和 Z 与它们所连接的碳原子一起代表可任意选择地被卤素-或烷基-取代的 5-或 6-元环,该环可任意选择地被一个或两个杂原子间断,条件是 X 和 V 不形成环,

m 代表 1 和 2,

条件是取代基 V, W, X, Y 或 Z 中至少一个基团必须不是氢,

$F^1$  和  $F^2$  每个代表下列基团之一



- A 代表氢或各自可任意选择地被卤素-取代的  $C_1-C_{12}$ -烷基、 $C_3-C_8$ -链烯基、 $C_1-C_{10}$ -烷氧基- $C_1-C_8$ -烷基、二-, 三-或四- $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_1-C_8$ -烷基、 $C_1-C_{10}$ -烷硫基- $C_1-C_6$ -烷基, 可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -烷基-或  $C_1-C_6$ -烷氧基-取代的  $C_3-C_8$ -环烷基, 其中可任意选择地一个或两个不直接相邻的环原子被氧和/或硫替换, 或代表各自可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -烷基-、 $C_1-C_6$ -卤代烷基-、 $C_1-C_6$ -烷氧基-、 $C_1-C_6$ -卤代烷氧基-、氰基-或硝基-取代的  $C_6$ -或  $C_{10}$ -芳基(苯基或萘基), 含有 5-6 个环原子的杂芳基(例如呋喃基, 吡啶基, 咪唑基, 三唑基, 吡唑基, 噻吩基, 噻唑基或噻吩基)或  $C_6$ -或  $C_{10}$ -芳基- $C_1-C_6$ -烷基(苯基- $C_1-C_6$ -烷基或萘基- $C_1-C_6$ -烷基),

B 代表氢、 $C_1-C_{12}$ -烷基或  $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基, 或

- A, B 与它们所连接的碳原子代表饱和的  $C_3-C_{10}$ -环烷基或不饱和的  $C_5-C_{10}$ -环烷基, 其中可任意选择地一个环原子被氧或硫替换并可任意选择地被  $C_1-C_8$ -烷基,  $C_3-C_{10}$ -环烷基,  $C_1-C_8$ -卤代烷基,  $C_1-C_8$ -烷氧基,  $C_1-C_8$ -烷硫基, 卤素或苯基-或二取代, 或

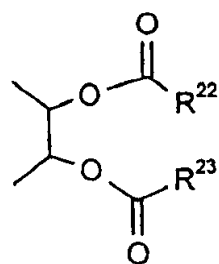
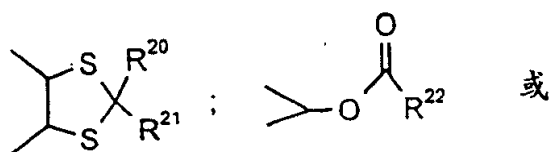
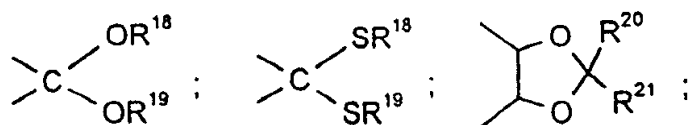
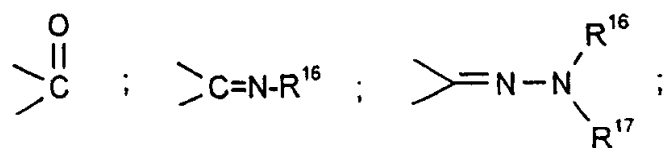
- A, B 与它们所连接的碳原子代表被烯二基取代的  $C_3-C_6$ -环烷基, 其中该烯二基可任意选择地含有一个或两个不直接相邻的氧和/或硫原子, 或被亚烷二氧基或亚烷二硫基取代的  $C_3-C_6$ -环烷基, 烯二基或亚烷二氧基或亚烷二硫基与它们所连接的碳原子一起形成另一五-至八元环, 或

A, B 与它们所连接的碳原子代表  $C_3-C_8$ -环烷基或  $C_5-C_8$ -环烯基, 其中两个取代基与它们所连接的碳原子一起代表各自可任意选择地被  $C_1-C_6$ -烷基-,  $C_1-C_6$ -烷氧基或卤素-取代的  $C_2-C_6$ -烷二基、 $C_2-C_6$ -烯二基或  $C_4-C_6$ -链烷二烯二基, 其中可任意选择地一个亚甲基被氧或硫替换,

D 代表氢, 各自可任意选择地被卤素-取代的  $C_1-C_{12}$ -烷基、 $C_3-C_8$ -链烯基、 $C_3-C_8$ -炔基、 $C_1-C_{10}$ -烷氧基- $C_2-C_8$ -烷基、二-, 三-或四- $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_2-C_8$ -烷基、 $C_1-C_{10}$ -烷硫基- $C_2-C_8$ -烷基, 可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_4$ -烷基-、 $C_1-C_4$ -烷氧基或  $C_1-C_4$ -卤代烷基-取代的  $C_3-C_8$ -环烷基, 其中可任意选择地一个环原子被氧或硫替换, 或代表各自可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -烷基-、 $C_1-C_6$ -卤代烷基-、 $C_1-C_6$ -烷氧基-、 $C_1-C_6$ -卤代烷氧基-、氟基-或硝基-取代的苯基, 含有 5 或 6 个环原子的杂芳基 (例如呋喃基, 咪唑基, 吡啶基, 噻唑基, 吡唑基, 嘧啶基, 吡咯基, 噻吩基或三唑基), 苯基- $C_1-C_6$ -烷基或含有 5 或 6 个环原子的杂芳基- $C_1-C_6$ -烷基 (例如呋喃基-, 咪唑基-, 吡啶基-, 噻唑基-, 吡唑基-, 嘧啶基-, 吡咯基-, 噻吩基-或三唑基- $C_1-C_6$ -烷基) 或代表基团  $CO-R^{11}$ , 或

A 和 D 一起代表各自可任意选择地取代的  $C_3-C_6$ -烷二基或  $C_3-C_6$ -烯二基, 其中可任意选择地一个亚甲基被羰基、氧或硫替换, 并且这里取代基各自可为:

卤素、羟基、巯基或各自可任意选择地被卤素-取代的  $C_1-C_{10}$ -烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基、 $C_1-C_6$ -烷硫基、 $C_3-C_7$ -环烷基、苯基或苄氧基, 其中可任意选择地两个相邻取代基与它们所连接的碳原子一起形成另一含有 5 或 6 个环原子的饱和或不饱和环 (当为结构式 (I-1) 化合物时, A 和 D 与它们所连接的原子一起代表, 例如下文进一步提及的基团 AD-1 至 AD-10), 该环可含有氧或硫, 或可任意选择地含有下列基团之一



或

- A 和 Q<sup>1</sup> 一起代表 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-烷二基或 C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>-烯二基，其中每个基团可任意选择地被卤素、羟基、被 C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷硫基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-环烷基或被苄氧基或苯基相同或不同地一-或二取代，其中 C<sub>1-10</sub> 烷基、C<sub>1-6</sub> 烷氧基、C<sub>1-6</sub> 烷硫基、C<sub>3-7</sub> 环烷基各自可任意选择地被卤素相同或不同地一至三取代，苄氧基或苯基各自可任意选择地被卤素、C<sub>1-6</sub> 烷基或 C<sub>1-6</sub> 烷氧基相同或不同地一至三取代，或代表可任意选择地被卤素-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的链烷二烯二基，条件是 B 和 Q<sup>2</sup> 与它们所连接的碳原子一起代表双键以及 W 或 X 中的至少一个取代基不代表氢，

- Q<sup>1</sup> 代表氢、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷硫基-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-烷基，可任意选择地被 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基-或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基-取代的 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-环烷基，其中可任意选择地一个亚甲基被氧或硫替换，或代表可任意选择地被卤素-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基-、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-卤代烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-卤代烷氧基-、氰基-或硝基-取代的苯基，或



烯基、 $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_2-C_8$ -烷基、多- $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_2-C_8$ -烷基，

代表可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -烷基-或  $C_1-C_6$ -烷氧基-取代的  $C_3-C_8$ -环烷基，或

代表各自可任意选择地被卤素-、氟基-、硝基-、 $C_1-C_6$ -烷基-、

- 5  $C_1-C_6$ -烷氧基-、 $C_1-C_6$ -卤代烷基-或  $C_1-C_6$ -卤代烷氧基-取代的苯基或苄基，

$R^3$  代表可任意选择地被卤素-取代的  $C_1-C_8$ -烷基或代表各自可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -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-、氟基-或硝基-取代的苯基或苄基，

- 10  $R^4$  和  $R^5$  各自独立地代表各自可任意选择地被卤素-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、 $C_2-C_8$ -链烯硫基、 $C_3-C_7$ -环烷硫基或代表各自可任意选择地被卤素-、硝基-、氟基-、 $C_1-C_4$ -烷氧基-、 $C_1-C_4$ -卤代烷氧基-、 $C_1-C_4$ -烷硫基-、 $C_1-C_4$ -卤代烷硫基-、 $C_1-C_4$ -烷基-或  $C_1-C_4$ -卤代烷基-取代的
- 15 苯基、苯氧基或苯硫基，

$R^6$  和  $R^7$  各自独立地代表氢，代表各自可任意选择地被卤素-取代的  $C_1-C_8$ -烷基、 $C_3-C_8$ -环烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基、 $C_3-C_8$ -链烯基、 $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_1-C_8$ -烷基，代表可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_8$ -卤代烷基-、 $C_1-C_8$ -烷基-或  $C_1-C_8$ -烷氧基-取代的苯基，可任意选择地被卤素-、

20  $C_1-C_8$ -烷基-、 $C_1-C_8$ -卤代烷基-或  $C_1-C_8$ -烷氧基-取代的苄基或与它们所连接的 N 原子一起代表可任意选择地被  $C_1-C_4$ -烷基取代的  $C_3-C_6$ -链烯基，其中可任意选择地一个碳原子被氧或硫替换，

- $R^8$  代表各自可任意选择地被卤素取代的  $C_1-C_{10}$ -烷基、 $C_3-C_8$ -链烯基、 $C_3-C_8$ -炔基、 $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_8$ -链烯氧基- $C_1-C_4$ -
- 25 烷基、 $C_3-C_8$ -炔氧基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_8$ -烷基羰基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基羰基- $C_1-C_4$ -烷基，代表可任意选择地被氟-、 $C_1-C_4$ -烷基-或  $C_1-C_4$ -烷氧基-取代的环烷基或代表可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -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-、氟基-或硝基-取代的苯基- $C_1-C_4$ -烷基、苯基羰基- $C_1-C_4$ -烷基或苯氧基- $C_1$ -
- 30  $C_4$ -烷基，

$R^9$  代表氢，可任意选择地被卤素取代的  $C_1-C_{10}$ -烷基、 $C_3-C_{10}$ -链烯基、 $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_1-C_8$ -烷基、 $C_1-C_8$ -烷硫基- $C_1-C_8$ -烷基、含有 3-8

个环原子的环烷基，其中该环烷基可被氧或硫原子间断，代表苯基、苯基- $C_1-C_6$ -烷基或苯氧基- $C_1-C_6$ -烷基或各自含有 5 或 6 个环原子的杂芳基- $C_1-C_6$ -烷基，其中环中含有 1 或 2 个相同或不同的氧、氮和硫原子，每个基团可任意选择地被卤素， $C_1-C_6$ -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，氰基或硝基相同或不同地一至三取代，或

$R^{10}$  代表氢、 $C_1-C_{10}$ -烷基、 $C_3-C_{10}$ -链烯基或代表基团  $CO-R^{11}$ ，或

$R^9$  和  $R^{10}$  与它们所连接的氮原子一起代表可任意选择地被  $C_1-C_4$ -烷基取代的三至七元饱和环，其中可任意选择地一个不直接与氮原子相邻的亚甲基被氧或硫原子替换，

$R^{11}$  代表氢，各自可任意选择地被卤素取代的  $C_1-C_{10}$ -烷基、 $C_3-C_{10}$ -链烯基、 $C_1-C_{10}$ -烷氧基，可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_4$ -烷基-、 $C_1-C_4$ -烷氧基-取代的  $C_3-C_8$ -环烷基或代表可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -烷基-、 $C_1-C_6$ -卤代烷基-、 $C_1-C_6$ -烷氧基-、 $C_1-C_6$ -卤代烷氧基-、氰基-或硝基-取代的苯基、苯基- $C_1-C_6$ -烷基、苄氧基或苯氧基，

$R^{16}$  代表氢，代表各自可任意选择地被卤素取代的  $C_1-C_8$ -烷基或  $C_1-C_8$ -烷氧基，代表可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_4$ -烷基-或  $C_1-C_4$ -烷氧基-取代的  $C_3-C_8$ -环烷基，其中可任意选择地一个亚甲基被氧或硫替换，或代表各自可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -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-、硝基-或氰基-取代的苯基、苯基- $C_1-C_4$ -烷基或苯基- $C_1-C_4$ -烷氧基，

$R^{17}$  代表氢或  $C_1-C_8$ -烷基，或

$R^{16}$  和  $R^{17}$  优选代表  $C_4-C_6$ -烷二基，

$R^{18}$  和  $R^{19}$  可相同或不同并代表  $C_1-C_6$ -烷基，或

$R^{18}$  和  $R^{19}$  一起代表可任意选择地被  $C_1-C_6$ -烷基、 $C_1-C_6$ -卤代烷基取代的或被可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -烷基-、 $C_1-C_4$ -卤代烷基-、 $C_1-C_6$ -烷氧基-、 $C_1-C_4$ -卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的苯基取代的  $C_2-C_4$ -烷二基，

$R^{20}$  和  $R^{21}$  各自独立地代表氢，代表可任意选择地卤素-取代的  $C_1-C_8$ -烷基或代表可任意选择地卤素-、 $C_1-C_6$ -烷基-、 $C_1-C_6$ -烷氧基-、 $C_1-C_4$ -卤代烷基-、 $C_1-C_4$ -卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的苯基，或

$R^{20}$  和  $R^{21}$  与它们所连接的碳原子一起代表羰基或代表可任意选择

地被卤素-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基-或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基-取代的 C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub>-环烷基，其中可任意选择地一个亚甲基被氧或硫替换，

R<sup>22</sup> 和 R<sup>23</sup> 各自独立地代表 C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-链烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-烷基氨基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-链烯基氨基、二-(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-烷基)氨基或二-(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-链烯基)氨基。

3. 权利要求 1 的式 (I) 化合物，其中

X 代表氢、氟、氯、溴、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷氧基、硝基或氰基或代表可任意选择地被氟-、氯-、溴-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基-、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-卤代烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的苯基、苯氧基或苄氧基，

V 代表氢、氟、氯、溴、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷氧基、苯基、硝基或氰基，

W 代表氢、氟、氯、溴、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷氧基、硝基或氰基，

Y 和 Z 各自独立地代表氢、氟、氯、溴、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷氧基、氰基、硝基或各自代表可任意选择地被氟-、氯-、溴-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-卤代烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基-、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-卤代烷氧基-、氰基-或硝基-取代的苯基、苯氧基或苄氧基，

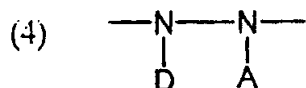
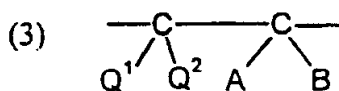
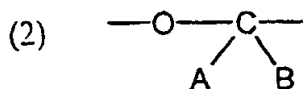
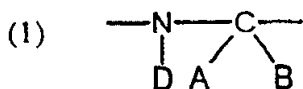
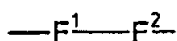
X 和 V 与它们所连接的碳原子一起代表可任意选择地被氟-、氯-或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基-取代的五或六元环，该环可任意选择地被两个不直接相邻的氧原子所间断，条件是 Y 和 Z 不形成环，

Y 和 Z 与它们所连接的碳原子一起代表可任意选择地被氟-、氯-或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基-取代的五或六元环，该环可任意选择地被一个或两个氧原子所间断，条件是 X 和 V 不形成环，

m 代表 1 和 2，

条件是取代基 V, W, X, Y 或 Z 中至少一个基团必须不代表氢，

F<sup>1</sup> 和 F<sup>2</sup> 各自代表下列基团之一



A 代表氢,各自可任意选择地被氟-或氯-取代的  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ -烷氧基-  $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基,可任意选择地被氟-、氯-、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-或  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基-取代的  $\text{C}_3\text{-C}_7$ -环烷基,其中可任意选择地一个环原子被氧或硫替换,或代表苯基或苯基- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基,其中每个基团可任意选择地被氟、氯、溴、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -卤代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基或  $\text{C}_1\text{-C}_2$ -卤代烷氧基、氰基或硝基一或二取代,

B 代表氢或  $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基,或

10 A, B 与它们所连接的碳原子代表饱和或不饱和的  $\text{C}_5\text{-C}_7$ -环烷基,其中可任意选择地一个环原子被氧或硫替换以及可任意选择地被  $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基、 $\text{C}_5\text{-C}_6$ -环烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -卤代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷氧基、氟、氯或苯基单取代,或

15 A, B 与它们所连接的碳原子代表被烯二基取代的  $\text{C}_5\text{-C}_6$ -环烷基,其中烯二基可任意选择地含有一个或两个不直接相邻的氧或硫原子或由亚烷二氧基取代的  $\text{C}_5\text{-C}_6$ -环烷基或被亚烷二硫基取代的  $\text{C}_5\text{-C}_6$ -环烷基,烯二基或亚烷二氧基或亚烷二硫基与它们所连接的碳原子一起可形成另一五或六元环,或

20 A, B 与它们所连接的碳原子代表  $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基或  $\text{C}_5\text{-C}_6$ -环烯基,其中两个取代基与它们所连接的碳原子一起代表  $\text{C}_2\text{-C}_4$ -烷二基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ -烯二基,其中可任意选择地一个亚甲基被氧或硫替换,  $\text{C}_2\text{-C}_4$  烷二基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$  烯二基可任意选择地被  $\text{C}_1\text{-C}_5$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_5$ -烷氧基、氟、氯

或溴取代,或代表丁二烯二基,

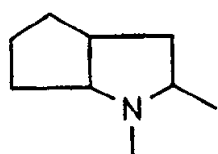
D 代表氢,代表各自可任意选择地被氟-或氯-取代的  $C_1-C_8$ -烷基、 $C_3-C_6$ -链烯基、 $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_2-C_4$ -烷基或  $C_1-C_6$ -烷硫基- $C_2-C_4$ -烷基,代表可任意选择地被氟-、氯-、 $C_1-C_4$ -烷基-、 $C_1-C_4$ -烷氧基-或

5  $C_1-C_2$ -卤代烷基取代的  $C_3-C_7$ -环烷基,其中可任意选择地一个亚甲基被氧或硫替换,或代表苯基或苯基- $C_1-C_2$ -烷基,每个基团可任意选择地被氟、氯、溴、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_2$ -卤代烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_2$ -卤代烷氧基、氰基或硝基一至二取代,或代表基团  $CO-R^{11}$ ,

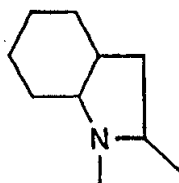
A 和 D 一起代表可任意选择地取代的  $C_3-C_5$ -烷二基,其中一个亚

10 甲基被羰基、氧或硫替换,这里,可能的取代基为羟基、 $C_1-C_6$ -烷基或  $C_1-C_4$ -烷氧基,或

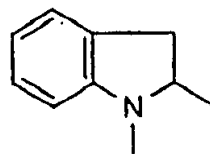
A 和 D(当为式(I-1)化合物的情况下)与它们所连接的原子一起代表 AD-1 至 AD-10 中的一个基团:



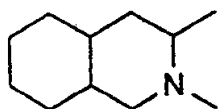
AD-1



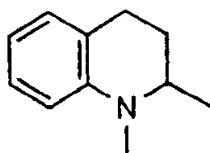
AD-2



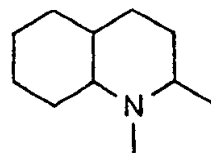
AD-3



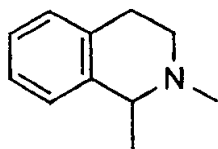
AD-4



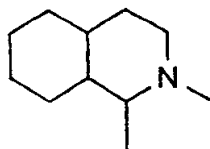
AD-5



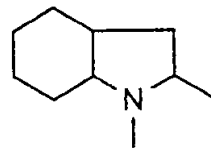
AD-6



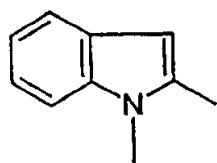
AD-7



AD-8



AD-9



AD-10

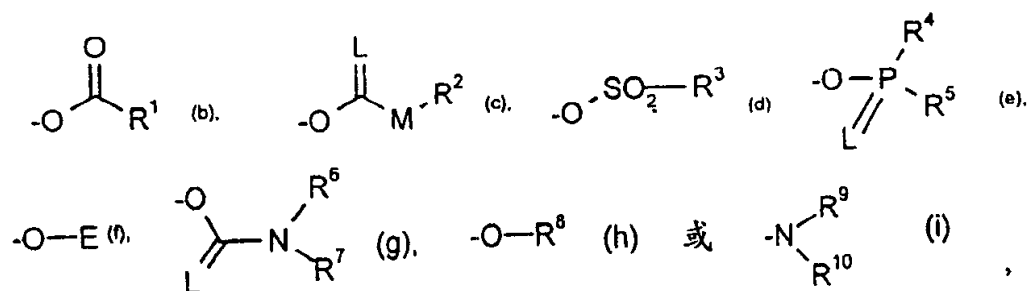
或

A 和  $Q^1$  一起代表  $C_3-C_4$ -烷二基或  $C_3-C_4$ -烯二基, 每个基团可任意选择地被羟基, 氟, 氯相同或不同地, 被  $C_1-C_8$ -烷基或  $C_1-C_4$ -烷氧基一或二取代, 其中  $C_1-C_8$ -烷基或  $C_1-C_4$ -烷氧基可任意选择地被氟一至三取代, 或代表烷二烯二基, 该基团可任意选择地被氟、氯、溴、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_2$ -卤代烷基、 $C_1-C_2$ -卤代烷氧基、硝基或氰基一至二取代, 条件是 B 和  $Q^2$  与它们所连接的碳原子一起代表双键以及取代基 W 或 X 中至少一个不代表氢,

$Q^1$  代表氢、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_1-C_2$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷硫基- $C_1-C_2$ -烷基或可任意选择地被甲基-或甲氧基-取代的  $C_3-C_6$ -环烷基, 其中可任意选择地一个亚甲基被氧或硫替换, 或

$Q^2$  代表氢或  $C_1-C_4$ -烷基,

G 代表羟基(a)或代表下列基团之一



其中

E 代表金属离子或铵离子,

L 代表氧或硫以及

M 代表氧或硫,

$R^1$  代表  $C_1-C_{16}$ -烷基、 $C_2-C_{16}$ -链烯基、 $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基、 $C_1-C_6$ -烷硫基- $C_1-C_4$ -烷基, 其中每个基团可任意选择地被氟或氯一至三取代, 或代表可任意选择地被氟-、氯-、 $C_1-C_5$ -烷基-或  $C_1-C_5$ -烷氧基取代的  $C_3-C_6$ -环烷基, 其中可任意选择地一个或两个不直接相邻的环原子被氧和/或硫替换,

代表苯基, 该苯基可任意选择地被氟、氯、溴、氰基、硝基、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_2$ -卤代烷基、 $C_1-C_2$ -卤代烷氧基、 $C_1-C_2$ -烷硫基或  $C_1-C_2$ -烷基磺酰基一至二取代,

代表苯基- $C_1-C_4$ -烷基,该苯基- $C_1-C_4$ -烷基可任意选择地被氟、氯、溴、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_3$ -卤代烷基或  $C_1-C_3$ -卤代烷氧基一至二取代,

5 代表吡唑基、噻唑基、吡啶基、嘧啶基、呋喃基或噻吩基,各自可任意选择地被氟、氯、溴或  $C_1-C_4$ -烷基一至二取代,

$R^2$  代表  $C_1-C_{16}$ -烷基、 $C_2-C_{16}$ -链烯基或  $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_2-C_6$ -烷基,其中每个基团可任意选择地被氟一至三取代,

10 代表苯基或苄基,各自可任意选择地被氟、氯、溴、氟基、硝基、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_3$ -烷氧基、 $C_1-C_2$ -卤代烷基或  $C_1-C_2$ -卤代烷氧基一至二取代,

$R^3$  代表可任意选择地被氟一至三取代的  $C_1-C_6$ -烷基,或代表苯基,该苯基可任意选择地被氟、氯、溴、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_2$ -卤代烷基、 $C_1-C_2$ -卤代烷氧基、氟基或硝基一至二取代,

15  $R^4$  和  $R^5$  各自独立地代表  $C_1-C_6$ -烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基、 $C_1-C_6$ -烷基氨基、二- $(C_1-C_6$ -烷基)氨基、 $C_1-C_6$ -烷硫基、 $C_3-C_4$ -烯硫基、 $C_3-C_6$ -环烷硫基或代表苯基、苯氧基或苯硫基,各自可任意选择地被氟、氯、溴、硝基、氟基、 $C_1-C_3$ -烷氧基、 $C_1-C_3$ -卤代烷氧基、 $C_1-C_3$ -烷基或  $C_1-C_3$ -卤代烷基一至二取代,

20  $R^6$  代表  $C_1-C_6$ -烷基、 $C_3-C_6$ -环烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基、 $C_3-C_6$ -链烯基、 $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基,代表苯基,该苯基可任意选择地被氟、氯、溴、 $C_1-C_3$ -卤代烷基、 $C_1-C_4$ -烷基或  $C_1-C_4$ -烷氧基一至二取代,代表苄基,该苄基可任意选择地被氟、氯、溴、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_3$ -卤代烷基或  $C_1-C_4$ -烷氧基一至二取代,

$R^7$  代表氢、 $C_1-C_6$ -烷基或  $C_3-C_6$ -链烯基,

25  $R^6$  和  $R^7$  与它们所连接的氮原子一起代表五或六元环,其中可任意选择地与氮原子不直接相邻的一个亚甲基被氧或硫原子替换以及可任意选择地被甲基或乙基一至二取代,

30  $R^8$  代表  $C_1-C_6$ -烷基、 $C_3-C_6$ -链烯基、 $C_3-C_6$ -炔基、 $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_1-C_2$ -烷基、 $C_3-C_6$ -烯氧基- $C_1-C_2$ -烷基、 $C_3-C_8$ -炔氧基- $C_1-C_2$ -烷基、 $C_1-C_6$ -烷基羰基- $C_1-C_2$ -烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基羰基- $C_1-C_2$ -烷基,其各自可任意选择地被氟或氯一至三取代,或代表苯基- $C_1-C_2$ -烷基、苯基羰基- $C_1-C_4$ -烷基或苯氧基- $C_1-C_2$ -烷基,其各自可任意选择地被氟、氯、



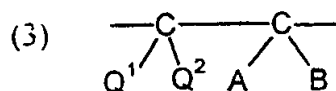
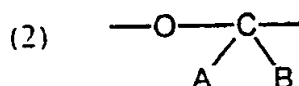
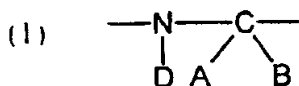
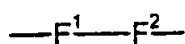
X 和 V 与它们所连接的碳原子一起代表可任意选择地被氟-或甲基-取代的五或六元环, 且该五或六元环被两个不直接相邻的氧原子间断, 条件是 Y 和 Z 不形成环,

5 Y 和 Z 与它们所连接的碳原子一起代表可任意选择地被氟-或甲基-取代的五或六元环, 且该五或六元环可被一个或两个不直接相邻的氧原子间断, 条件是 X 和 V 不形成环,

m 代表 2, 条件是取代基 V, W, X, Y 或 Z 中至少一个基团必须不代表氢,

F<sup>1</sup> 和 F<sup>2</sup> 各自代表下列基团之一

10



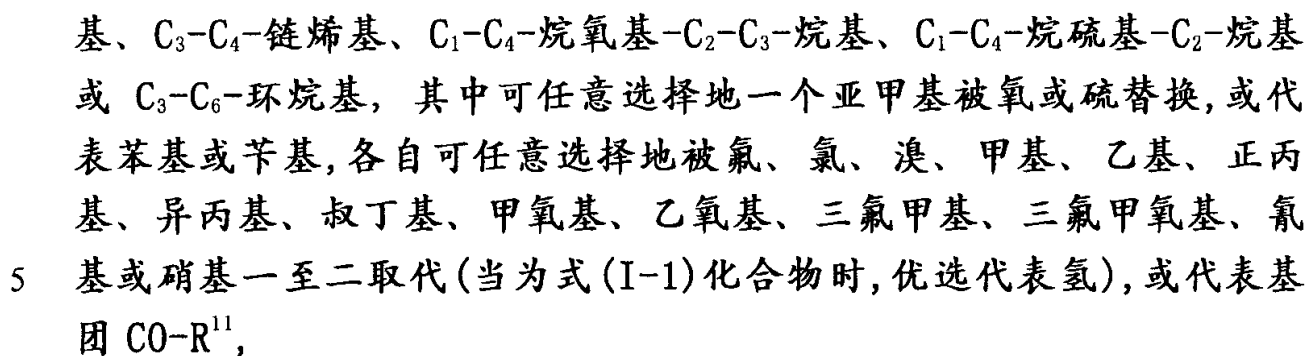
15 A 代表氢, 可任意选择地被氟取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基, 可任意选择地被氟-、甲基-或甲氧基-取代的 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烷基或代表苯基或苄基, 各自可任意选择地被氟、氯、溴、甲基、异丙基、叔丁基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或硝基一至二取代,

B 代表氢或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基, 或

20 A, B 与它们所连接的碳原子代表饱和的 C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-环烷基, 其中可任意选择地一个环原子被氧或硫替换并且可任意选择地被甲基、乙基、正丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、氟或氯一取代, 或

A, B 与它们所连接的碳原子代表 C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-环烷基, 其中两个取代基与它们连接的碳原子一起代表 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-烷二基或 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-烯二基, 其中各自可任意选择地一个亚甲基被氧或硫替换, 或代表丁二烯二基,

25 D 代表氢, 代表各自可任意选择地被氟-或氯-取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷



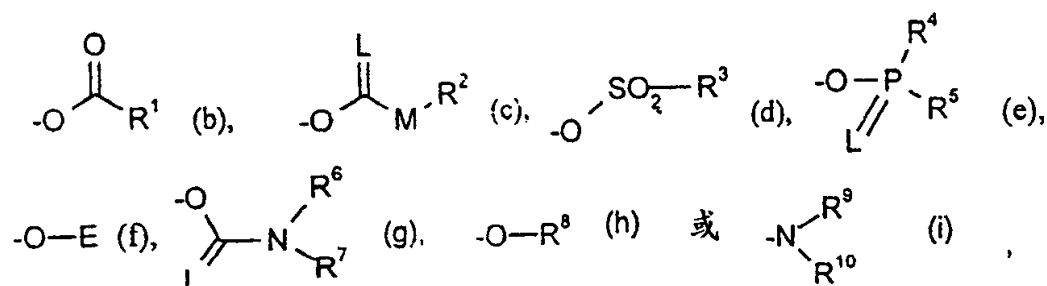
A 和 D 一起代表可任意选择地取代的 C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-烷二基, 其中可任意选择地一个碳原子被硫替换并且可任意选择地被甲基取代, 或

10 A 和 D(当为式(I-1)化合物的情况下)与它们所连接的原子一起代表基团 AD-1 至 AD-10 之一:



15 A 和 Q<sup>1</sup> 一起代表 C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-烷二基或丁烯二基, 各自可任意选择地被氟、氯、羟基、甲基或甲氧基一至二取代, 或代表烷二烯二基, 该烷二烯二基可任意选择地被氟、氯、溴、甲基、甲氧基、三氟甲氧基、氰基或硝基一至二取代, 条件是 B 和 Q<sup>2</sup> 与它们所连接的碳原子一起代表双键以及取代基 W 或 X 中至少一个不代表氢,

G 代表羧基 (a) 或代表下列基团之一



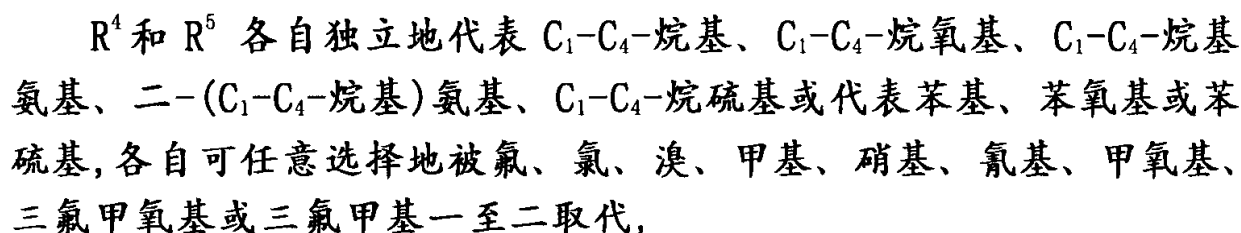
E 代表金属离子或铵离子,

M 代表氧或硫，

15 代表苯基, 该苯基可任意选择地被氟、氯、溴、氰基、硝基、甲基、乙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、三氟甲基或三氟甲氧基一至二取代。

20  $R^2$  代表  $C_1-C_{10}$ -烷基、 $C_2-C_{10}$ -链烯基或  $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_2-C_4$ -烷基，各自可任意选择地被氟一至三取代，

25  $R^3$  代表甲基、乙基、正丙基、异丙基,各自可任意选择地被氟一至三取代,或代表苯基,该苯基可任意选择地被氟、氯、溴、甲基、叔丁基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氨基或硝基一取代,



5  $R^6$  代表  $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_6$ -环烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_3-C_4$ -链烯基、 $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基, 代表苄基, 该苄基可任意选择地被氟、氯、溴、三氟甲基、甲基或甲氧基一至二取代, 代表苞基, 该苞基可任意选择地被氟、氯、溴、甲基、三氟甲基或甲氧基一至二取代,

$R^7$  代表氢、 $C_1$ - $C_4$ -烷基或  $C_3$ - $C_4$ -链烯基,

10  $R^6$  和  $R^7$  与它们所连接的氮原子一起代表五或六元环, 其中可任意选择地与氮原子不直接相邻的一个亚甲基被氧或硫原子替换并且可任意选择地被甲基一至二取代,

15  $R^8$  代表  $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_4$ -链烯基、 $C_1-C_4$ -烷氧基-甲基、 $C_3-C_4$ -烯氧基-甲基、 $C_3-C_4$ -炔氧基-甲基、 $C_1-C_4$ -烷基羰基-甲基、 $C_1-C_4$ -烷氧基羰基-甲基,各自可任意选择地被氟或氯一至三取代,或代表苄基、苯基羰基-甲基或苯氧基-甲基,各自可任意选择地被氟、氯、溴、甲基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或硝基一至二取代,

R<sup>9</sup> 代表氢,代表 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、烯丙基、环丙基、环戊基、环己基,各自可任意选择地被氟或氯一至三取代,代表苄基,该苄基可任意选择地被氟、氯、溴、甲基、乙基、异丙基、叔丁基、甲氧基、异丙氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氨基或硝基一至二取代,

$R^{10}$  代表氢、 $C_1$ - $C_4$ -烷基、烯丙基或代表基团  $CO-R^{11}$ , 或

$R^9$  和  $R^{10}$  与它们所连接的氮原子一起代表饱和的五至六元环, 其中可任意选择地与氮原子不直接相邻的一个亚甲基被氧或硫原子替换并且可任意选择地被甲基一至二取代,

$R^{11}$  代表氢, 代表  $C_1-C_4$ -烷基,  $C_3-C_4$ -链烯基,  $C_1-C_4$ -烷氧基, 各自可任意选择地被氟或氯一至三取代, 代表环丙基, 环戊基或环己基, 各自可任意选择地被氟, 氯, 甲基或甲氧基一取代, 或代表苯基, 该苯基可任意选择地被氟、氯、溴、甲基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氨基或硝基一至二取代。

5. 权利要求 1 的式 (I) 化合物, 其中

V 代表氢、氟、氯、溴、甲基、三氟甲基、硝基或苯基,

W 代表氢、氟、氯、溴、甲基、乙基,

X 代表氢、氟、氯、溴、甲基、甲氧基、乙基、正丙基、异丙基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、三氟甲基或硝基、氰基,

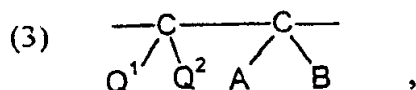
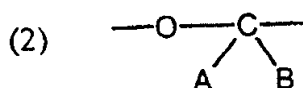
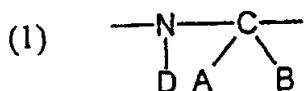
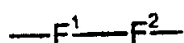
Y 代表氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、异丙基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、异丙氧基、二氟甲基、三氟甲基、三氟甲氧基、二氟甲氧基或苯基,

Z 代表氢、氟、氯、溴、甲基、三氟甲基,

Y 和 Z 与它们所连接的碳原子一起形成五元环, 该五元环可被一个或两个不直接相邻的氧原子间断, 条件是 X 和 V 不形成环,

10 m 代表 2, 条件是取代基 V, W, X, Y 或 Z 中至少一个基团必须不代表氢,

$F^1$  和  $F^2$  各自代表下列基团之一



15 其中

A 代表氢、 $C_1$ - $C_4$ -烷基, 代表苯基或苄基, 各自可任意选择地被氯或氟一至二取代,

B 代表氢或  $C_1$ - $C_4$ -烷基,

20 A 和 B 与它们所连接的碳原子代表饱和的环己基, 其中可任意选择一个环原子被氧替换以及可任意选择地被甲基、乙基、正丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、氟或氯取代,

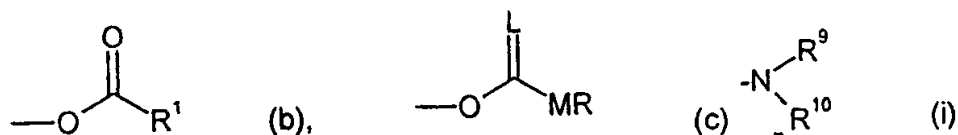
D 代表氢、 $C_1$ - $C_4$ -烷基, 代表苯基或苄基, 各自可任意选择地被氯、氟、溴一至二取代, 或代表基团  $CO-R^{11}$ ,

25 A 和  $Q^1$  一起代表  $C_3$ - $C_4$ -烷二基或丁烯二基, 各自可任意选择地被

甲基、氯或氯一至二取代，或代表可任意选择地被甲基或氯一至二取代的烷二烯二基，

条件是 B 和 Q<sup>2</sup> 与它们所连接的碳原子一起代表双键以及取代基 W 或 X 中至少一个基团不代表氢，

5 G 代表羟基 (a) 代表



R<sup>1</sup> 代表 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基，

R<sup>2</sup> 代表 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基，

10 L 和 M 代表氧，

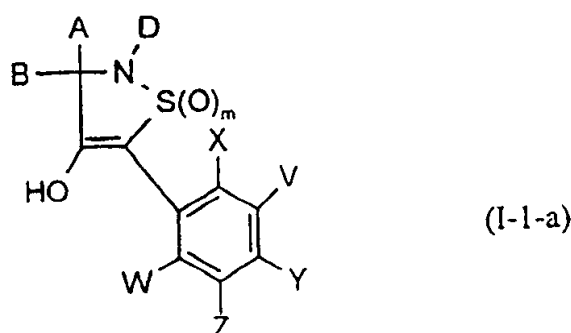
R<sup>9</sup> 代表氢，

R<sup>10</sup> 代表氢或代表基团 CO-R<sup>11</sup>，

R<sup>11</sup> 代表 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基。

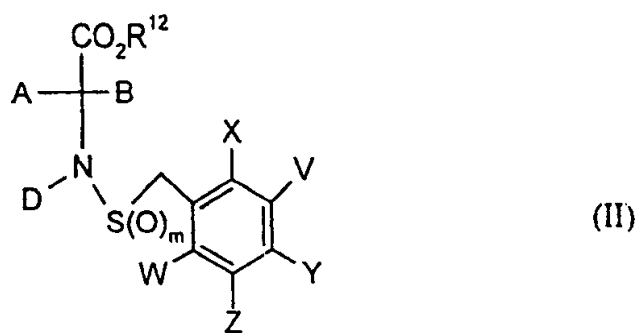
6. 权利要求 1 的式 (I) 化合物的制备方法，其特征在于可通过下述方法获得：

(A) 式 (I-1-a) 化合物是通过下述方法获得的



其中

20 A, B, D, V, W, X, Y, Z 和 m 如权利要求 1 所述定义  
即将式 (II) 化合物



其中

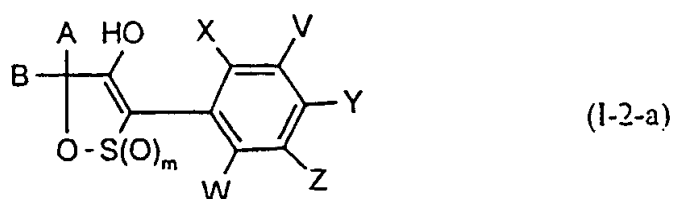
A, B, D, V, W, X, Y, Z 和 m 如权利要求 1 所述定义

和

$R^{12}$  代表烷基

在存在稀释剂和存在碱的条件下进行分子内缩合而获得。

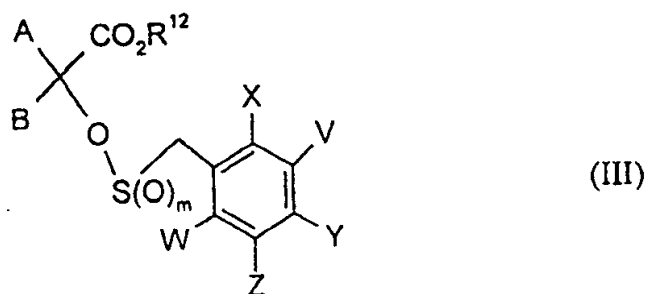
(B) 式 (I-2-a) 化合物可通过以下方法获得



其中

A, B, V, W, X, Y, Z 和 m 如上面所述定义

即将式 (III) 化合物

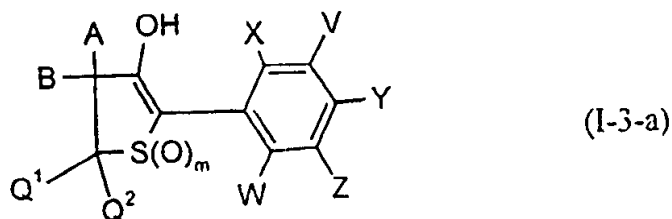


其中

A, B, V, W, X, Y, Z,  $R^{12}$  和 m 如上面所述定义

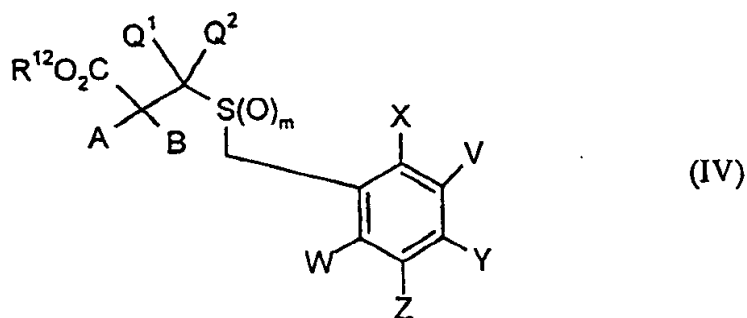
在存在稀释剂和存在碱的条件下进行分子内缩合而获得。

(C) 式 (I-3-a) 化合物可通过下述方法获得



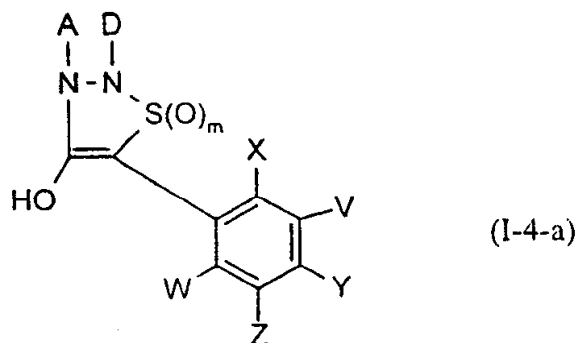
其中

- 5 A, B,  $Q^1$ ,  $Q^2$ , V, W, X, Y, Z 和 m 如权利要求 1 所述定义  
即将式 (IV) 化合物



其中

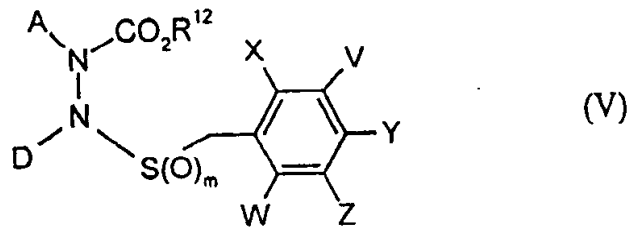
- 10 A, B,  $Q^1$ ,  $Q^2$ , V, W, X, Y, Z 和 m 如权利要求 1 所述定义以及  
 $R^{12}$  代表烷基  
如需要存在稀释剂和存在碱的条件下分子内环化而获得。  
(D) 式 (I-4-a) 化合物可通过下述方法获得



其中

A, D, V, W, X, Y, Z 和 m 如权利要求 1 所述定义

即将式 (V) 化合物



其中

5      A, D, V, W, X, Y, Z 和 m 如权利要求 1 所述定义以及  
 $R^{12}$  代表烷基或可任意选择地取代的苯基

如需要在存在稀释剂和存在碱的条件下环化而获得, 以及如需要  
 随后将上述获得的式 I-1-a, I-2-a, I-3-a 和 I-4-a 化合物  
 (E) ( $\alpha$ ) 与式 (VI) 化合物反应

10



其中

$R^1$  定义同上以及  
 Hal 代表卤素(氯或溴)

15

或  
 ( $\beta$ ) 与式 (VII) 化合物反应

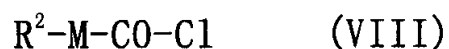


其中

$R^1$  定义同上,

20

如需要在存在稀释剂以及如需要存在酸结合剂的条件下反应;  
 (F) 与式 (VIII) 化合物反应

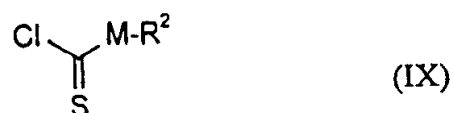


其中

$R^2$  和 M 定义同上,

25

如需要在存在稀释剂以及如需要存在酸结合剂的条件下反应;  
 (G) 与式 (IX) 化合物反应



其中

M 和 R<sup>2</sup> 定义同上,

5 如需要在存在稀释剂以及如需要在存在酸结合剂的条件下反应,  
以及

(H) 与式 (X) 化合物反应



其中

10 R<sup>3</sup> 定义同上,

如需要在存在稀释剂以及如需要在存在酸结合剂的条件下反应,  
(I) 与式 (XI) 化合物反应



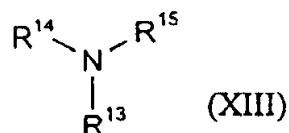
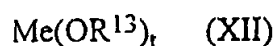
15 其中

L, R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 定义同上以及

Hal 代表卤素,

如需要在存在稀释剂以及如需要在存在酸结合剂的条件下反应,  
(J) 与式 (XII) 或 (XIII) 的化合物反应

20

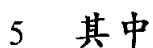


其中

Me 代表一-或二价金属,

t 代表 1 或 2 以及

(K) ( $\alpha$ )与式(XIV)化合物反应



如需要存在稀释剂以及如需要存在催化剂的条件下进行反应,或

10



如需要在存在稀释剂以及如需要存在酸结合剂的条件下反应,

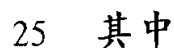
15



U 代表氯、溴、碘和  $O-SO_2-R^{16}$  以及

20 苯基,

(M) ( $\alpha$ )与式(XVII)化合物反应

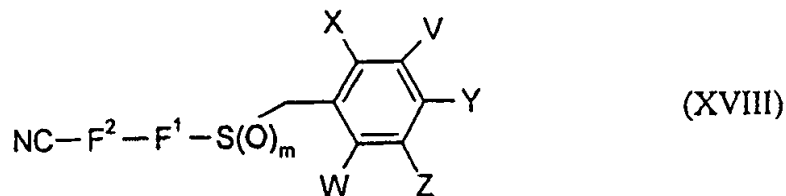


在存在溶剂,如需要存在酸性催化剂,蒸馏除去共沸混合物或存

在脱水剂(例如分子筛)的条件下进行反应,

或

(β) 当  $R^9$  和  $R^{10}$  代表氢的情况下, 使式 (XVIII) 化合物

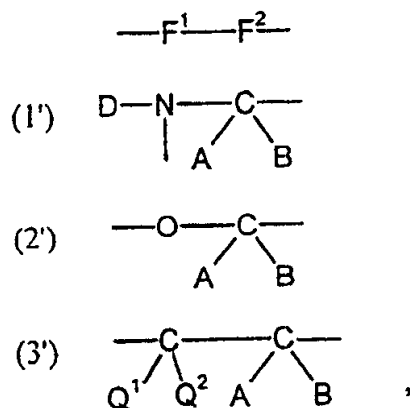


5

其中

V, W, X, Y, Z, 和 m 定义同上以及

$F^1$  和  $F^2$  代表下列基团

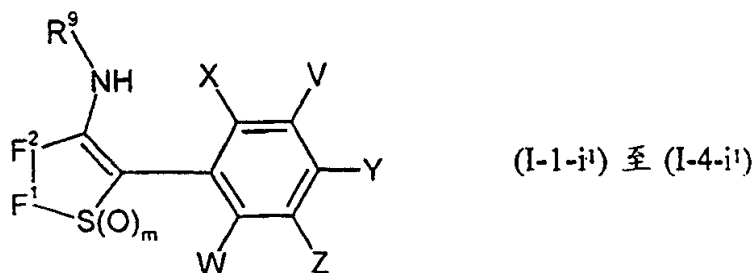


10

上述基团中 A, B, D,  $Q^1$  和  $Q^2$  定义同上

在存在溶剂以及存在碱的条件下进行分子内环化,

以及如需要, 随后将式 (I-1-i<sup>1</sup>) 至 (I-4-i<sup>1</sup>) 化合物



15

其中

$F^1$ ,  $F^2$ ,  $R^9$ , V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上

(N)  $\alpha$ ) 与式 (XIX) 化合物反应



其中

- 5  $\text{R}^{11}$  定义同上, 但不代表氢,  
 $\text{Hal}$  代表卤素,  
 如需要在存在稀释剂以及如需要在存在酸结合剂的条件下反应,  
 或

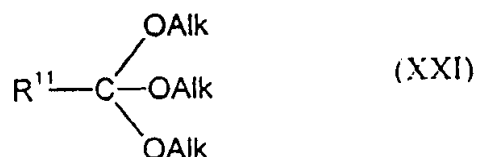
$\beta$ ) 与式 (XX) 化合物反应



其中

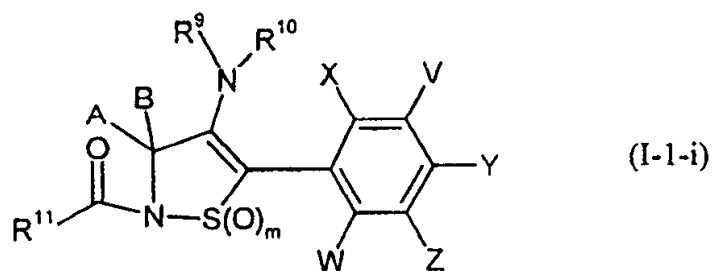
- $\text{R}^{11}$  定义同上以及, 各自独立地, 可为相同或不同基团, 但不代表  
 氢,  
 如需要在存在稀释剂以及如需要在存在酸结合剂的条件下反应,  
 15 这里, 还可以使用式 (XVIII) 和 (XIX) 试剂的混合物,  
 或

$\gamma$ ) 与式 (XXI) 化合物反应



20 其中

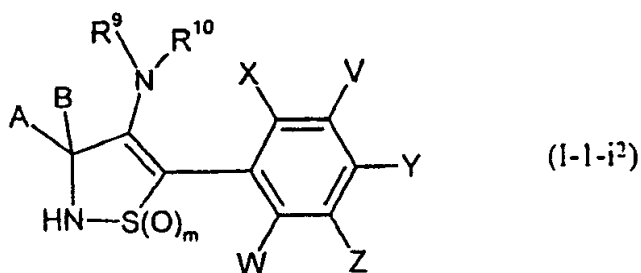
- $\text{R}^{11}$  代表氢  
 以及  
 $\text{Alk}$  代表  $\text{C}_1-\text{C}_4$ -烷基,  
 如需要在存在稀释剂以及如需要在存在碱的条件下反应,  
 25 (O) 式 (I-1-i) 化合物可通过下述方法获得



其中

A, B, R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup>, V, W, X, Y, Z 和 m 定义同上,

5 即将式 (I-1-i<sup>2</sup>) 化合物



其中

A, B, R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup>, V, W, X, Y, Z 和 m 定义同上,

10 与通式 (XIX) 化合物反应



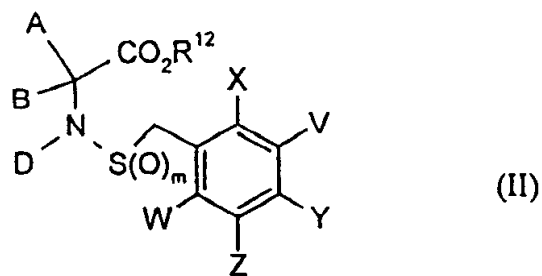
其中

R<sup>11</sup> 定义同上, 但不代表氢,

15 Hal 代表卤素,

如需要存在稀释剂并存在碱的条件下进行反应。

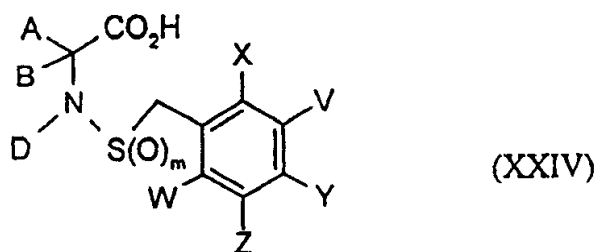
7. 式 (II) 化合物



其中

A, B, D, V, W, X, Y, Z,  $R^{12}$  和  $m$  定义同上。

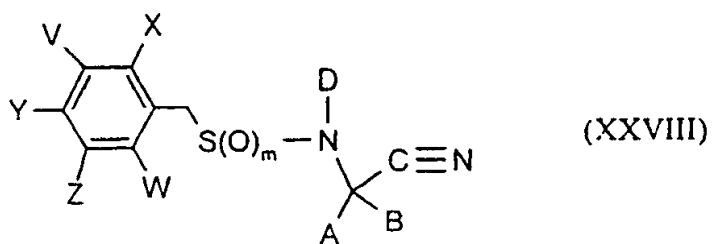
5 8. 式 (XXIV) 化合物



其中

A, B, D, V, W, X, Y, Z 和  $m$  定义同上。

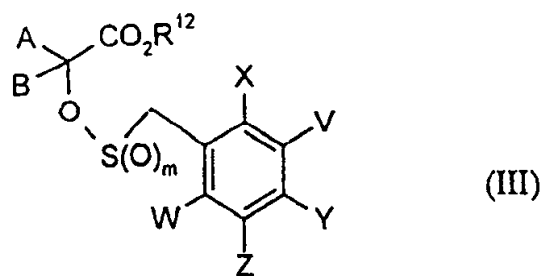
10 9. 式 (XXVIII) 化合物



其中

A, B, D, V, W, X, Y, Z 和  $m$  定义同上。

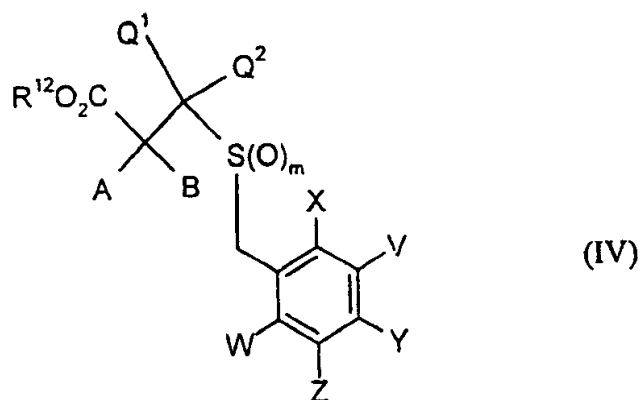
15 10. 式 (III) 化合物



其中

A, B, V, W, X, Y, Z,  $R^{12}$  和  $m$  定义同上。

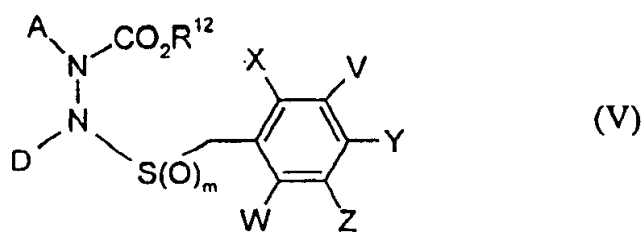
5 11. 式 (IV) 化合物



其中

A, B,  $Q^1$ ,  $Q^2$ , V, W, X, Y, Z,  $m$  和  $R^{12}$  定义同上。

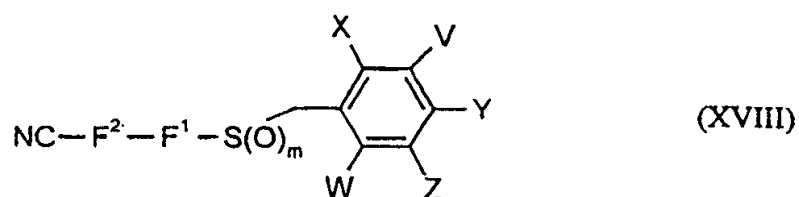
10 12. 式 (V) 化合物



其中

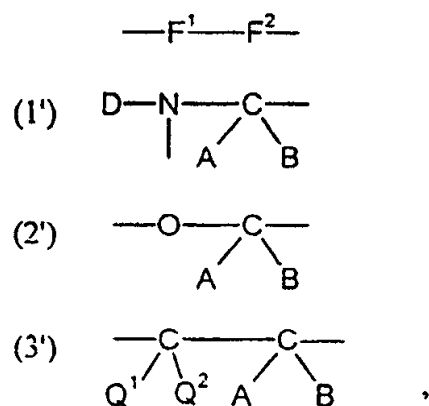
A, D, V, W, X, Y, Z,  $m$  和  $R^{12}$  定义同上。

15 13. 式 (XVIII) 化合物



其中

- 5 V, W, X, Y, Z 和 m 定义同上以及  
F<sup>1</sup> 和 F<sup>2</sup> 代表下列基团



其中基团 A, B, D, Q<sup>1</sup> 和 Q<sup>2</sup> 定义同上。

- 10 14. 杀虫剂, 除草剂和杀菌剂, 其特征在于它们包含至少一种权利要求 1 的式 (I) 化合物。

15. 害虫, 真菌和不需要植物的控制方法, 其特征在于将权利要求 1 的式 (I) 化合物作用于害虫和/或它们的栖息地。

16. 权利要求 1 的式 (I) 化合物控制害虫, 真菌和不需要植物的用途。

- 15 17. 杀虫剂, 除草剂和杀菌剂的制备方法, 其特征在于将权利要求 1 的式 (I) 化合物与填充剂和/或表面活性剂混合而完成。

18. 权利要求 1 的式 (I) 化合物制备杀虫剂, 除草剂和杀菌剂的用途。

## 说 明 书

 $\alpha$ -苯基- $\beta$ -酮基砜

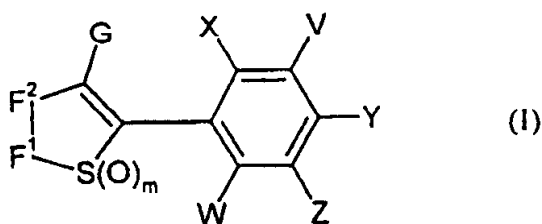
5 本发明涉及新的芳基-取代的  $S(0)_n$  环( $\alpha$ -苯基- $\beta$ -酮基砜), 以及它们的多种制备方法和它们在农业上的应用, 例如用作作物保护剂(例如杀菌剂, 除草剂和杀虫剂)。

文献中已经公开了 4-氨基-5-苯基-3-乙基-2-甲基-2,3-二氢异噻唑 1,1-二氧化物(J. L. Marco 等, Tetrahedron Letters 39, 4123 (1998)), 4-氨基-5-苯基-3,3-二甲基-2-苄基-2,3-二氢异噻唑 1,1-  
10 二氧化物和 4-氨基-5-苯基-3,3-二甲基-2-(3-氯-苄基)-2,3-二氢异噻唑 1,1-二氧化物(S. T. Ingate 等, Tetrahedron 53, 17795(1997)). 还公开了 2-甲基-5-苯基-异噻唑烷-4-酮 1,1-二氧化物, 2,3-二甲基-5-苯基-异噻唑烷-4-酮 1,1-二氧化物和 5-苯基-2,3,3-三甲基-异噻唑烷-4-酮 1,1-二氧化物(H. -D. Stachel,  
15 G. Drasch, Archiv Pharm. 318, 304 (1985)). 但迄今还没有公开这些化合物作为作物保护剂或农药的应用。

另外已知 3-苯基-1,2-氧硫戊环(oxathiolan)-4-酮 2,2-二氧化物, 5-甲基-3-苯基-1,2-氧硫戊环-4-酮 2,2-二氧化物, 5,5-二甲基-3-苯基-1,2-氧硫戊环-4-酮 2,2-二氧化物(H. D. Stachel,  
20 G. Drasch, Archiv. Pharm. 318, 304(1985)), 5-氨基-5,5-二甲基-3-苯基-1,2-氧硫戊环 2,2-二氧化物和 4-氨基-5-甲基-3-苯基-5-苯基甲基-1,2-氧硫戊环 2,2-二氧化物(S. T. Ingate 等, Tetrahedron 53, 17795(1997)). 但迄今还没有公开这些化合物作为作物保护剂或农药的应用。

25 已公开 2-芳基苯并[b]噻吩-3(2H)-酮 1,1-二氧化物作为抗炎剂和抗凝血剂(J. G. Lombardino, E. H. Wiseman, J. Med. Chem., 13, 206 (1970)). 还公开了 2-苯基-3-酮基-四氢噻吩 1,1-二氧化物(A. Abdel-Wahab 等, Phosphorus, Sulfur and Silicon, 59, 149 (1991)). 另外已知 2-苯基苯并[b]噻吩-3-胺, 2-苯基苯并[b]-噻吩  
30 -3-胺 1-氧化物和 2-苯基苯并[b]噻吩-3-胺 1,1-二氧化物(J. R. Beck, J. Heterocyclic Chem. 15, 513 (1978)). 同样, 迄今还没有公开这些化合物作为作物保护剂或农药的应用。

因此,发现了新的通式(I)的芳基-取代的  $S(O)_m$  环



其中

- 5 V, W, X, Y 和 Z 每个各自独立地代表氢、卤素、硝基、氰基或选自下列的基团:烷基、链烯基、炔基、烷氧基、 $S(O)_n$ -烷基、卤代烷基、卤代烷氧基,各自可任意选择地取代的芳基、苯基烷基、芳氧基、苯基-烷氧基或芳基- $S(O)_n$ -,其中两个邻近基团与它们连接的碳原子一起形成可任意选择地取代的环,该环可任意选择地由一个或多个杂原子间断;
- 10

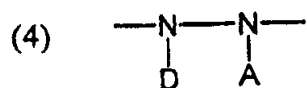
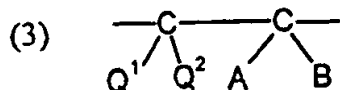
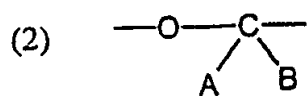
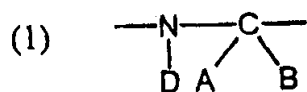
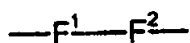
条件是取代基 V, W, X, Y 或 Z 中至少一个基团必须不是氢,

n 代表 0-2 的数,

m 代表 1 和 2,

$F^1$  和  $F^2$  代表下列基团之一

15



其中

A 代表氢,各自可任意选择地被卤素取代的烷基、链烯基、烷氧

基烷基、多烷氧基烷基、烷硫基烷基、饱和或不饱和的,可任意选择地取代的环烷基,其中可任意选择地至少一个环原子被杂原子替换,或代表各自可任意选择地被卤素-、烷基-、卤代烷基-、烷氧基-、卤代烷氧基-、氨基-或硝基-取代的芳基、芳烷基或杂芳基,

A 和 B 与它们所连接的碳原子一起代表饱和或不饱和的, 未取代或取代的环, 其中可任意选择地含有至少一个杂原子,

A 和 D 与它们所连接的原子一起代表饱和或不饱和环, 其中在 A, D-部分是未取代或取代的且可任意选择地含有至少一个(另外在  $F^1-F^2 = (4)$  的情况下)杂原子, 或

Q<sup>1</sup> 代表氢、烷基、烷氧基烷基、烷硫基烷基, 饱和或不饱和, 可任意选择地取代的环烷基, 其中可任意选择地一个或多个环原子被杂原子替换, 或代表可任意选择地取代的苯基,

25 G 代表羧基 (a) 或代表下列基团之一:



其中

E 代表金属离子或铵离子,

L 代表氧或硫,

M 代表氧或硫,

5  $R^1$  代表各自可任意选择地被卤素取代的烷基、链烯基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、多烷氧基烷基或可任意选择地被卤素-、烷基-或烷氧基-取代的环烷基, 其中一个或多个亚甲基可被杂原子替换, 或代表各自可任意选择地取代的苯基、苯基烷基、杂芳基、苯氧基烷基或杂芳氧基烷基,

10  $R^2$  代表各自可任意选择地被卤素取代的烷基、链烯基、烷氧基烷基、多烷氧基烷基或代表各自可任意选择地取代的环烷基、苯基或苄基,

$R^3, R^4$  和  $R^5$  各自独立地代表各自可任意选择地被卤素取代的烷基、烷氧基、烷基氨基、二烷基氨基、烷硫基、链烯硫基、环烷硫基  
15 和代表各自可任意选择地取代的苯基、苄基、苯氧基或苯硫基以及

$R^6$  和  $R^7$  各自独立地代表氢, 各自可任意选择地被卤素取代的烷基、环烷基、链烯基、烷氧基、烷氧基烷基, 代表可任意选择地取代的苯基, 代表可任意选择地取代的苄基, 或与它们所连接的 N 原子一起代表可任意选择地取代的环, 其中该环可任意选择地被氧或硫间  
20 断,

$R^8$  代表各自可任意选择地被卤素取代的烷基、烷氧基烷基、链烯基、链烯氧基烷基、炔基、炔氧基烷基、烷基羰基烷基、烷氧基羰基烷基或代表可任意选择地取代的环烷基或代表可任意选择地取代的芳烷基、芳基羰基烷基或苯氧基烷基,

25  $R^9$  和  $R^{10}$  各自独立地代表氢、烷基、链烯基、烷氧基烷基、烷硫基烷基, 代表可任意选择地被杂原子所间断的环烷基, 代表各自可任意选择地取代的苯基、苯基烷基、苯氧基烷基、杂芳基或杂芳基烷基, 或

$R^9$  和  $R^{10}$  与它们所连接的氮原子一起形成 3-至 9-元环, 其中该  
30 环可任意选择地被取代且可任意选择地被其它杂原子间断, 或

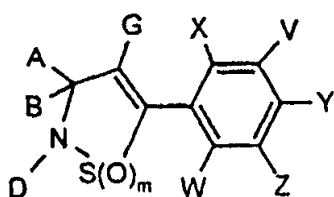
$R^{10}$  代表基团  $CO-R^{11}$ , 其中

$R^{11}$  代表氢, 可任意选择地被卤素取代的烷基、链烯基、烷氧

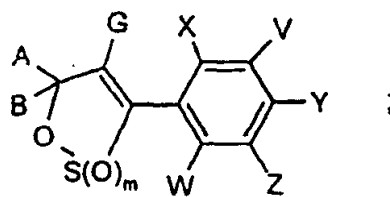
基,可任意选择地取代的环烷基,其中该环烷基可任意选择地被杂原子间断,或代表可任意选择地取代的芳基、芳烷基、芳烷氧基或苯氧基,其中可能的取代基是卤素、硝基、氰基、烷基、烷氧基、卤代烷基和卤代烷氧基。

- 5 特别是根据取代基性质,式(I)化合物可以以几何异构体和/或旋光异构体或不同组分的异构体混合物形式存在,如需要可通过常规方式分离。本发明涉及纯异构体和异构体混合物,它们的制备方法和应用以及含有它们的组合物。然而,下文为叙述简便起见,式(I)化合物始终既可以表示纯化合物,如需要也可表示具有不同比例异构体化合物的混合物。

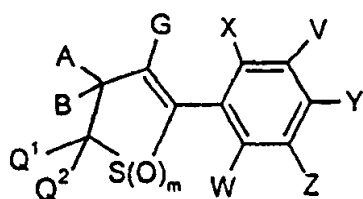
结合基团  $-F^1-F^2-$  的定义 (1)-(4), 获得下列主结构 (I-1) 至 (I-4):



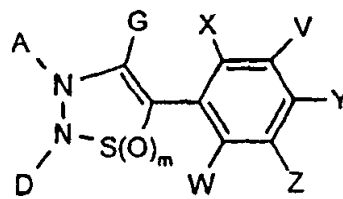
(I-1)



(I-2)



(I-3)



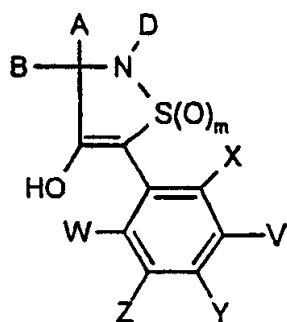
(I-4)

15 其中

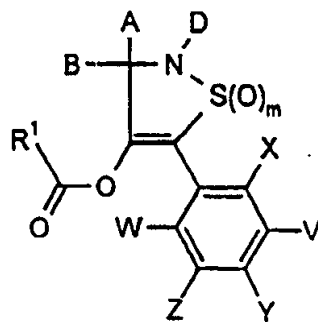
A, B, D, G,  $Q^1$ ,  $Q^2$ , V, W, X, Y, Z 和 m 定义同上。

结合基团 G 的不同定义 (a), (b), (c), (d), (e), (f), (g), (h) 和 (i), 如果  $-F^1-F^2-$  代表基团 (1), 则获得下列主结构 (I-1-a) 至 (I-1-i):

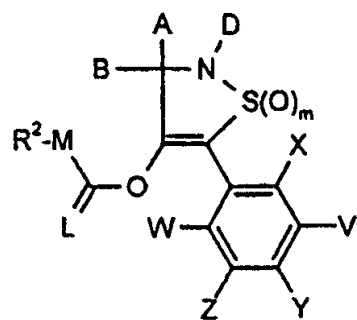
(I-1-a):



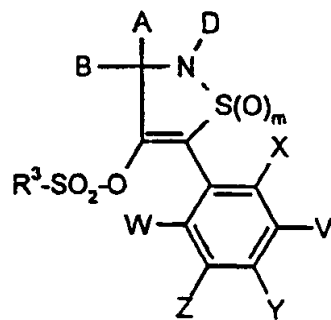
(I-1-b):



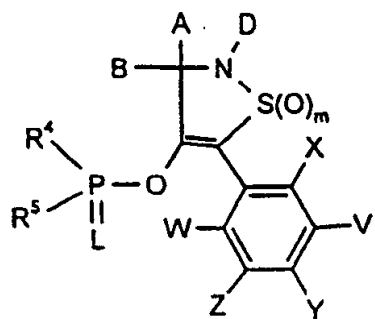
(I-1-c):



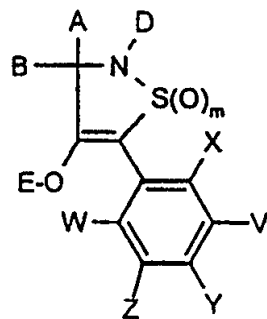
(I-1-d):



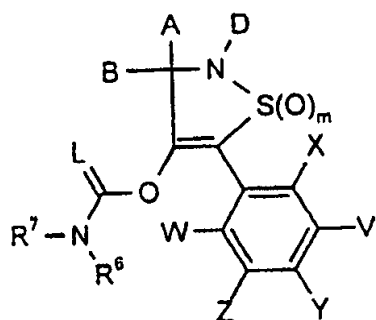
(I-1-e):



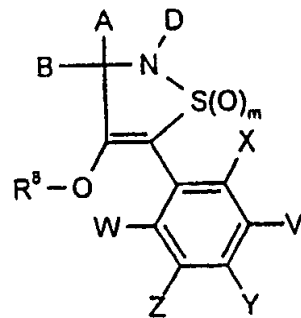
(I-1-f):



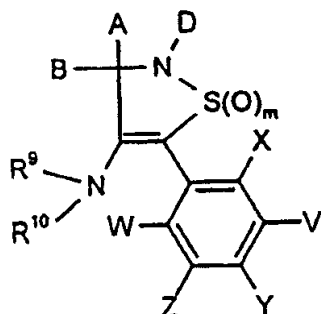
(I-1-g):



(I-1-h):



(I-1-i):

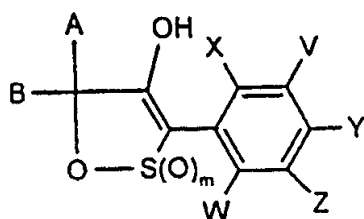


其中

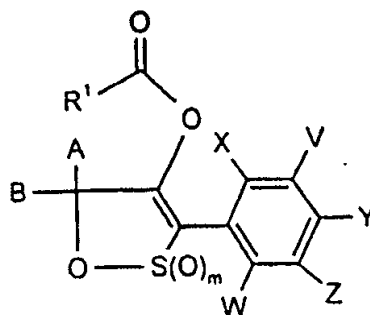
A, B, D, E, L, M, V, W, X, Y, Z,  $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}$  和  $m$  的定义同上。

结合基团 G 的不同定义 (a), (b), (c), (d), (e), (f), (g), (h) 和 (i), 如果  $-F^1-F^2-$  代表基团 (2), 获得下列主结构基团 (I-2-a) 至 (I-2-i):

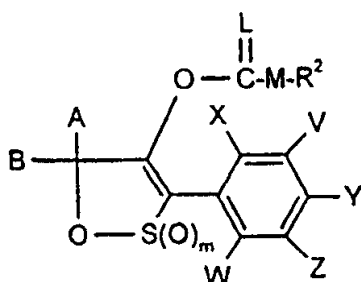
(I-2-a):



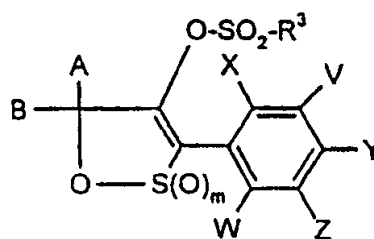
(I-2-b):



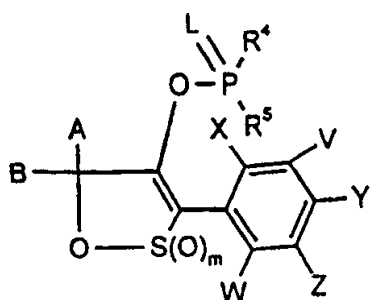
(I-2-c):



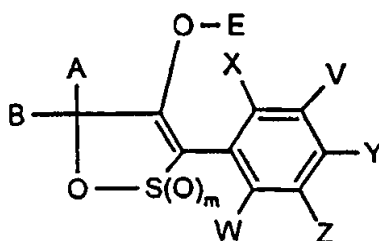
(I-2-d):



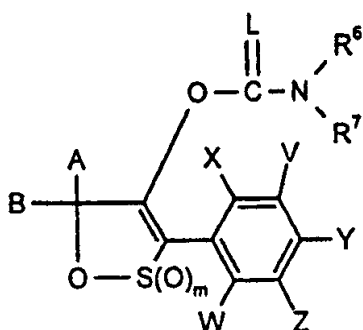
(I-2-e):



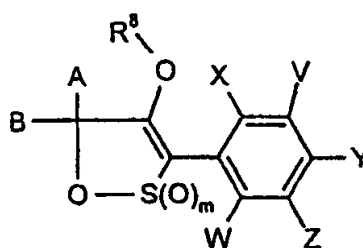
(I-2-f):



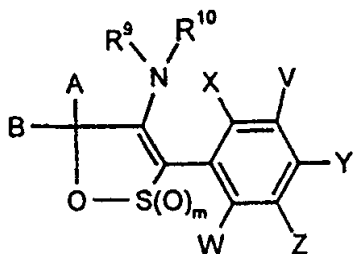
(I-2-g):



(I-2-h):



(I-2-i):

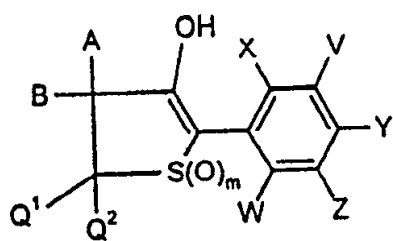


其中

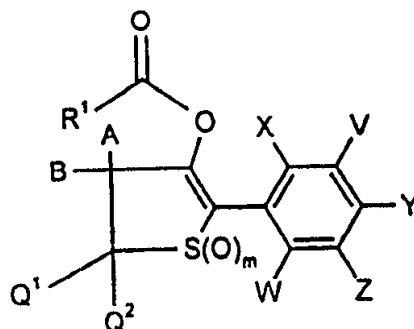
A, B, E, L, M, V, W, X, Y, Z, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup> 和 m 的定义  
5 同上。

结合基团 G 的不同定义 (a), (b), (c), (d), (e), (f), (g), (h) 和 (i), 如果 -F<sup>1</sup>-F<sup>2</sup>- 代表基团 (3), 则获得下列主结构 (I-3-a) 至 (I-3-i):

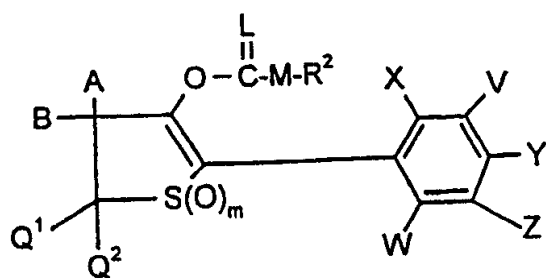
(I-3-a):



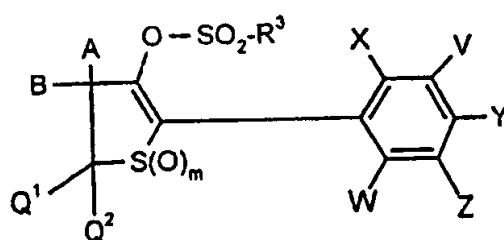
(I-3-b):



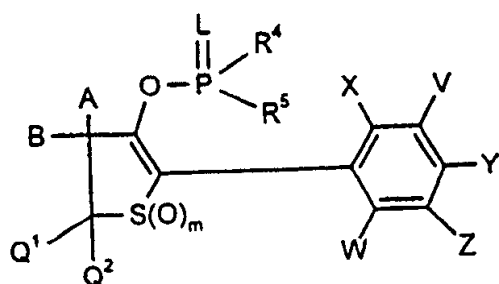
(I-3-c):



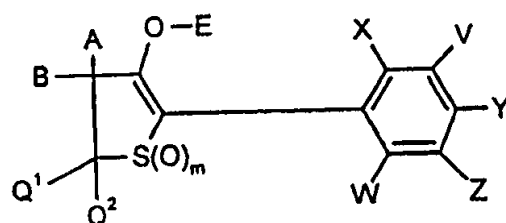
(I-3-d):



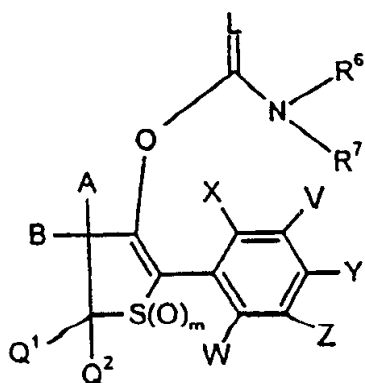
(I-3-e):



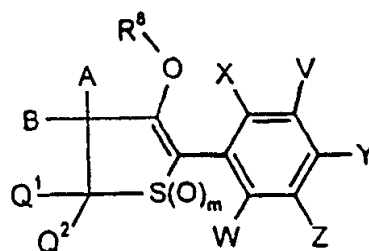
(I-3-f):



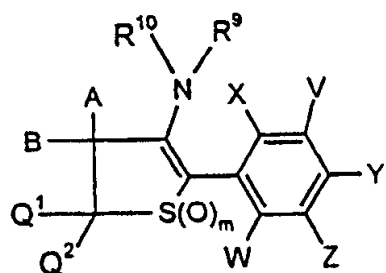
(I-3-g):



(I-3-h):



(I-3-i):

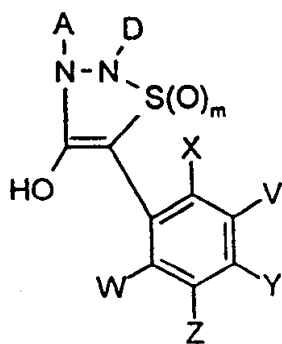


其中

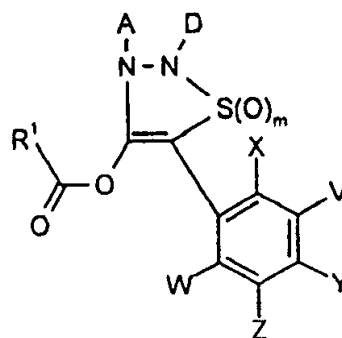
A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, E, L, M, V, W, X, Y, Z, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup> 和 m 的定义同上。

结合基团 G 的不同定义 (a), (b), (c), (d), (e), (f), (g), (h) 和 (i), 如果 -F<sup>1</sup>-F<sup>2</sup>- 代表基团 (4), 则获得下列主结构 (I-4-a) 至 (I-4-i):

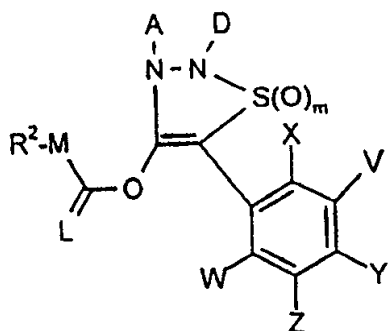
(I-4-a):



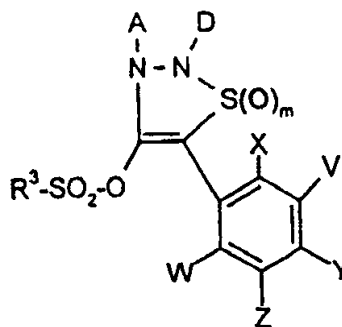
(I-4-b):



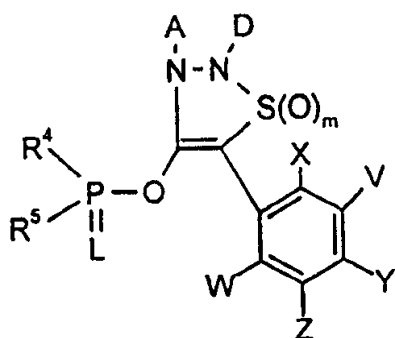
(I-4-c):



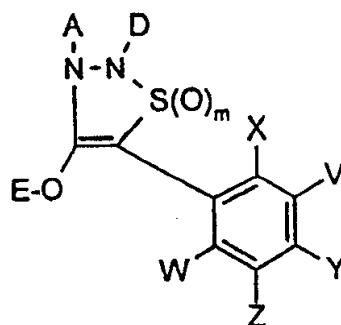
(I-4-d):



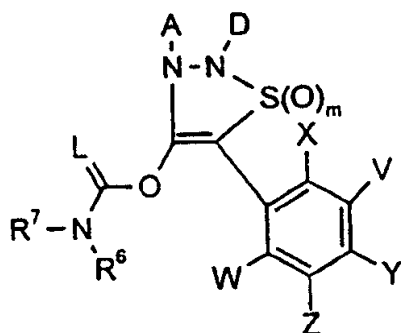
(I-4-e):



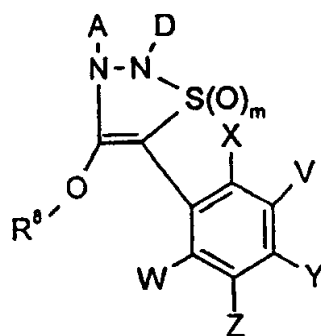
(I-4-f):



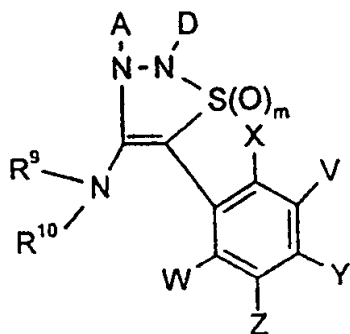
(I-4-g):



(I-4-h):



(I-4-i):



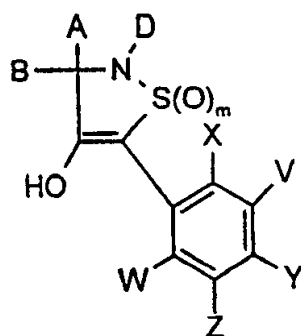
其中

A, D, E, L, M, V, W, X, Y, Z, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup> 和 m 的定

5 义同上。

另外, 已发现式 (I) 的新化合物可通过下述方法之一获得:

(A) 取代的式 (I-1-a) 化合物是通过下述方法获得的



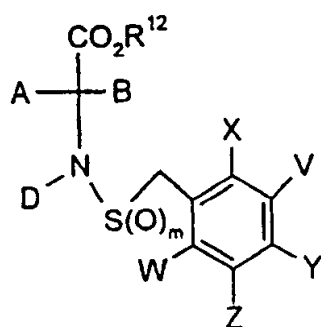
(I-1-a)

其中

A, B, D, V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上

5

即将式 (II) 的氨基酸酯



(II)

其中

A, B, D, V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上

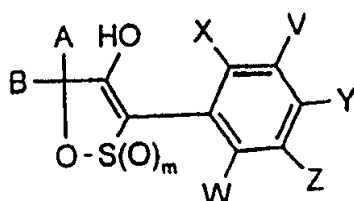
10

和

$R^{12}$  代表烷基 (优选  $C_1$ - $C_6$ -烷基)

在存在稀释剂和存在碱的条件下进行分子内缩合获得。

(B) 而且, 已发现取代的式 (I-2-a) 化合物可通过以下方法获得



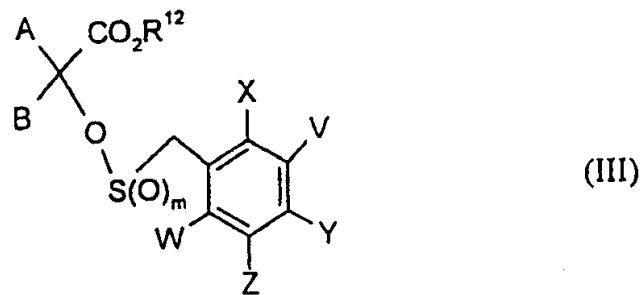
(I-2-a)

15

其中

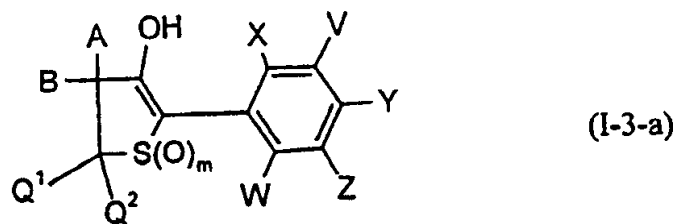
A, B, V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上

即将式(III)的羧酸酯



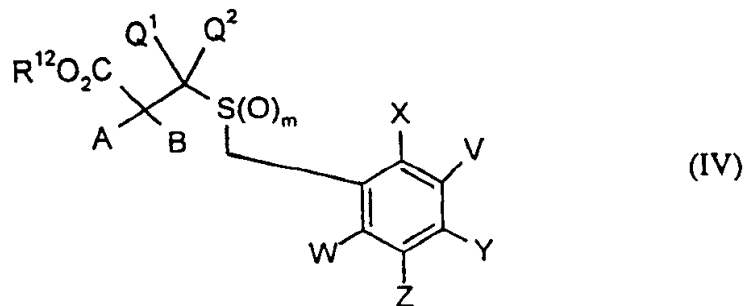
其中

- 5      A, B, V, W, X, Y, Z, R<sup>12</sup> 和 m 的定义同上  
 在存在稀释剂和存在碱的条件下进行分子内缩合而获得。  
 另外, 已发现  
 (C) 式(I-3-a)化合物可通过下述方法获得



其中

- 10      A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上  
 即将式(IV)的羧酸酯



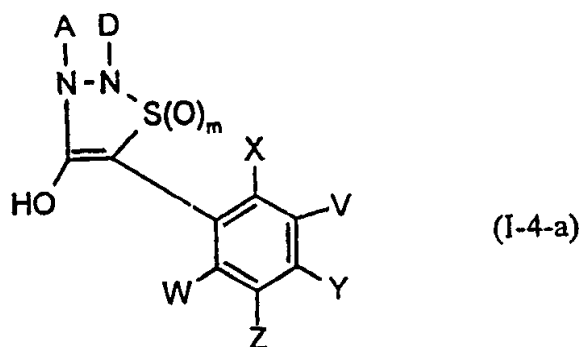
其中

- 15      A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上以及

$R^{12}$  代表烷基 (特别是  $C_1$ - $C_8$ -烷基)

如需要存在稀释剂和存在碱的条件下分子内环化而获得。

(D) 另外, 取代的式 (I-4-a) 化合物可通过下述方法获得

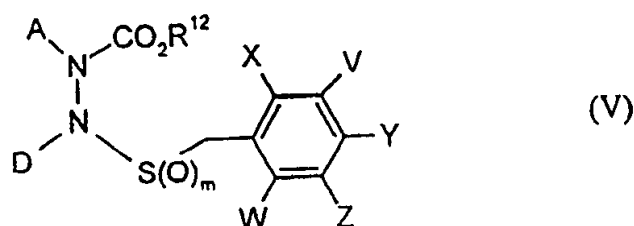


5

其中

A, D, V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上

即将式 (V) 的酰肼



10

其中

A, D, V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上以及

$R^{12}$  代表烷基 (特别是  $C_1$ - $C_6$ -烷基) 或可任意选择地取代的苯基 (特别是被卤素-或硝基-取代的苯基)

15

如需要在存在稀释剂和存在碱的条件下环化而获得。

而且, 已发现

(E) 上述的式 (I-1-b) 至 (I-4-b) 化合物, 其中 A, B, D,  $Q^1$ ,  $Q^2$ ,  $R^1$ , V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上, 是通过下述方法获得的, 即将上述的式 (I-1-a) 至 (I-4-a) 化合物, 其中 A, B, D,  $Q^1$ ,  $Q^2$ , V, W, X, Y, Z 和 m 的定

20

义同上, 各自

( $\alpha$ ) 与式 (VI) 的酰基卤反应



其中

$\text{R}^1$  定义同上以及

5 Hal 代表卤素(特别是氯或溴)

或

( $\beta$ ) 与式(VII)的羧酸酐反应



其中

10  $\text{R}^1$  定义同上,

如需要在存在稀释剂以及如需要在存在酸结合剂的条件下反应;

(F) 上述的式(I-1-c)至(I-4-c)化合物, 其中 A, B, D,  $\text{Q}^1$ ,  $\text{Q}^2$ ,  $\text{R}^2$ , M, V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上以及 L 代表氧, 是通过下述方法获得的, 即将上述的式(I-1-a)至(I-4-a)化合物, 其中

15 A, B, D,  $\text{Q}^1$ ,  $\text{Q}^2$ , V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上, 各自

与式(VIII)的氯甲酸酯或氯甲酸硫代酯反应



其中

$\text{R}^2$  和 M 定义同上,

20 如需要在存在稀释剂以及如需要在存在酸结合剂的条件下反应;

(G) 上述的式(I-1-c)至(I-4-c)化合物, 其中 A, B, D,  $\text{Q}^1$ ,  $\text{Q}^2$ ,  $\text{R}^2$ , M, V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上以及 L 代表硫, 是通过下述方法获得的, 即将上述的式(I-1-a)至(I-4-a)化合物, 其中 A, B, D,  $\text{Q}^1$ ,  $\text{Q}^2$ , V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上, 各自

25 与式(IX)的氯一硫代甲酸酯或氯二硫代甲酸酯反应



其中

M 和  $R^2$  定义同上,

如需要在存在稀释剂以及如需要在存在酸结合剂的条件下反应,  
和

- 5 (H) 上述的式 (I-1-d) 至 (I-4-d) 化合物, 其中 A, B, D,  $Q^1$ ,  $Q^2$ ,  $R^3$ , V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上, 是通过下述方法获得的, 即将上述的式 (I-1-a) 至 (I-4-a) 化合物, 其中 A, B, D,  $Q^1$ ,  $Q^2$ , V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上, 各自

与式 (X) 的磺酰氯反应



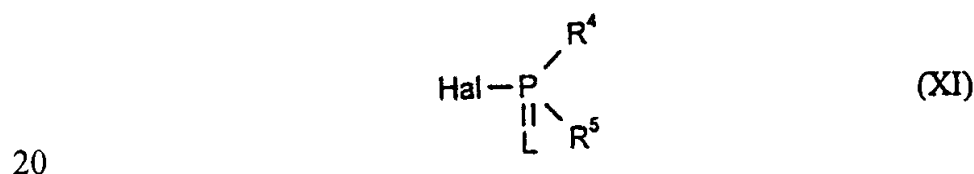
其中

$R^3$  定义同上,

如需要在存在稀释剂以及如需要在存在酸结合剂的条件下反应,

- 15 (I) 上述的式 (I-1-e) 至 (I-4-e) 化合物, 其中 A, B, D, L,  $Q^1$ ,  $Q^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ , V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上, 是通过下述方法获得的, 即将上述的式 (I-1-a) 至 (I-4-a) 化合物, 其中 A, B, D,  $Q^1$ ,  $Q^2$ , V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上, 各自

与式 (XI) 的含磷化合物反应



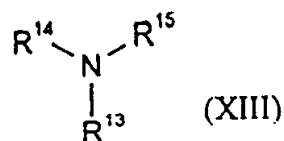
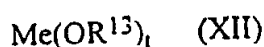
其中

L,  $R^4$  和  $R^5$  定义同上以及

Hal 代表卤素 (特别是氯或溴),

如需要在存在稀释剂以及如需要在存在酸结合剂的条件下反应,

- 25 (J) 上述的式 (I-1-f) 至 (I-4-f) 化合物, 其中 A, B, D, E,  $Q^1$ ,  $Q^2$ , V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上, 是通过下述方法获得的, 即将式 (I-1-a) 至 (I-4-a) 化合物, 其中 A, B, D,  $Q^1$ ,  $Q^2$ , V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上, 各自与式 (XII) 或 (XIII) 的金属化合物或胺反应



其中

Me 代表一-或二价金属(优选碱金属或碱土金属,如锂、钠、钾、  
5 镁或钙),

t 代表 1 或 2 以及

$\text{R}^{13}, \text{R}^{14}, \text{R}^{15}$  各自独立地代表氢或烷基(优选  $\text{C}_1\text{-C}_8$ -烷基),

如需要存在稀释剂条件下进行反应,

(K)上述的式(I-1-g)至(I-4-g)化合物,其中 A, B, D, L,  $\text{Q}^1, \text{Q}^2, \text{R}^6,$   
10  $\text{R}^7, \text{V}, \text{W}, \text{X}, \text{Y}, \text{Z}$  和 m 的定义同上,是通过下述方法获得的,即将上述的  
式(I-1-a)至(I-4-a)化合物,其中 A, B, D,  $\text{Q}^1, \text{Q}^2, \text{V}, \text{W}, \text{X}, \text{Y}, \text{Z}$  和 m 的定  
义同上,各自

与

( $\alpha$ ) 式(XIV)的异氰酸酯或异硫氰酸酯反应



其中

$\text{R}^6$  和 L 定义同上,

如需要存在稀释剂以及如需要存在催化剂的条件下进行反应,或

( $\beta$ ) 与式(XV)的氨基甲酰基氯或硫代氨基甲酰基氯反应

20



其中

L,  $\text{R}^6$  和  $\text{R}^7$  定义同上,

如需要在存在稀释剂以及如需要存在酸结合剂的条件下反应,

(L)上述的式(I-1-h)至(I-4-h)化合物,其中 A, B, D,  $\text{Q}^1, \text{Q}^2, \text{R}^8, \text{V},$   
25  $\text{W}, \text{X}, \text{Y}, \text{Z}$  和 m 的定义同上,是通过下述方法获得的,即将上述的式(I-  
1-a)至(I-4-a)化合物,其中 A, B, D,  $\text{Q}^1, \text{Q}^2, \text{V}, \text{W}, \text{X}, \text{Y}, \text{Z}$  和 m 的定义同

上,

与式(XVI)化合物反应



其中

5  $R^{10}$  定义同上,

$U$  代表氯、溴、碘和  $O-SO_2-R^{16}$  以及

$R^{16}$  代表可任意选择地被卤素取代的烷基(特别是三氟甲基)或可任意选择地取代的苯基(特别是被甲基-, 氯-, 溴-或硝基-取代的苯基),

10 如需要在存在稀释剂以及如需要在存在酸结合剂的条件下反应,

(M) 上述的式(I-1-i)至(I-4-i)化合物, 其中 A, B, D,  $Q^1$ ,  $Q^2$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$ , V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上, 其中  $R^{10}$  不代表基团  $CO-R^{11}$ , 是通过下述方法获得的, 即

( $\alpha$ ) 式(I-1-a)至(I-4-a)化合物, 其中 A, B, D,  $Q^1$ ,  $Q^2$ , V, W, X, Y, Z  
15 和 m 的定义同上, 与式(XVII)化合物反应



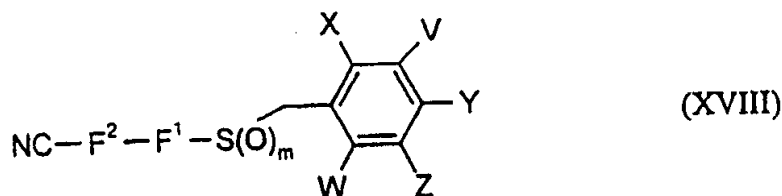
其中

$R^9$  和  $R^{10}$  定义同上以及  $R^{10}$  不代表基团  $CO-R^{11}$ ,

20 在存在溶剂, 如需要在存在酸性催化剂, 蒸馏除去共沸混合物或存在脱水剂(例如分子筛)的条件下进行反应,

或

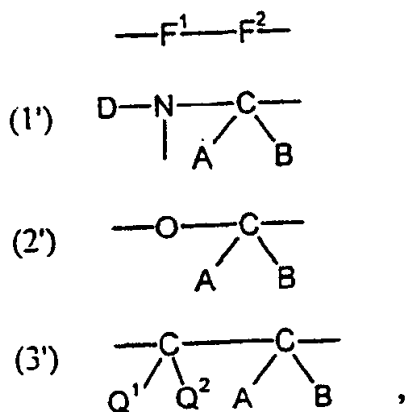
( $\beta$ ) 当  $R^9$  和  $R^{10}$  代表氢的情况下, 使式(XVIII)的腈



25

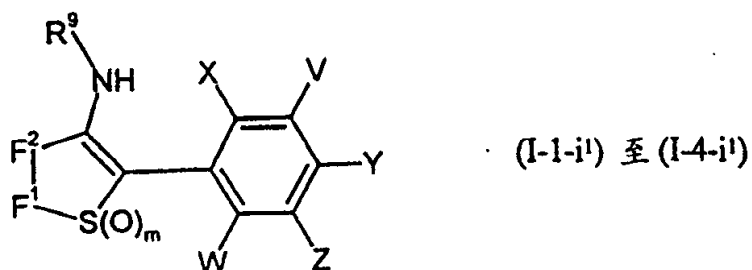
其中

V, W, X, Y, Z, 和 m 定义同上以及  
 $F^1$  和  $F^2$  代表下列基团



- 5 上述基团中 A, B, D,  $Q^1$  和  $Q^2$  定义同上  
 存在溶剂以及存在碱的条件下进行分子内环化,  
 (N) 上述的式 (I-1-i) 至 (I-4-i) 化合物, 其中 A, B, D,  $Q^1$ ,  $Q^2$ ,  $R^9$ , V,  
 W, X, Y, Z 和 m 的定义同上以及  $R^{10}$  代表基团  $\text{CO-R}^{11}$ , 是通过下述方法获  
 得的, 即将式 (I-1-i<sup>1</sup>) 至 (I-4-i<sup>1</sup>) 化合物

10



其中

$F^1$ ,  $F^2$ ,  $R^9$ , V, W, X, Y, Z 和 m 的定义同上  
 $\alpha$ ) 与式 (XIX) 的酰基卤反应

15



其中

$R^{11}$  定义同上, 但不代表氢,

Hal 代表卤素,特别是氯和溴,

如需要在存在稀释剂以及如需要存在酸结合剂的条件下反应,  
或

$\beta$ ) 与式 (XX) 的羧酸酐反应

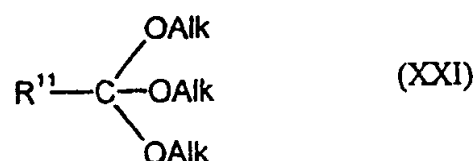


其中

$R^{11}$  定义同上以及,各自独立地,可为相同或不同基团,但不代表  
氢,

10 如需要在存在稀释剂以及如需要存在酸结合剂的条件下反应,  
其中,还可以使用式 (XVIII) 和 (XIX) 试剂的混合物,  
或

$\gamma$ ) 与式 (XXI) 的原甲酸酯反应



15 其中

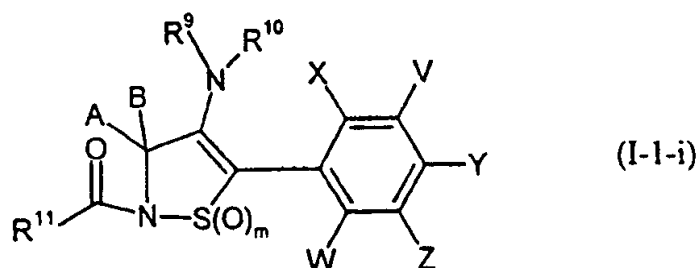
$R^{11}$  代表氢

以及

Alk 代表  $C_1-C_4$ -烷基(特别是甲基或乙基),

如需要在存在稀释剂以及如需要存在碱的条件下反应,

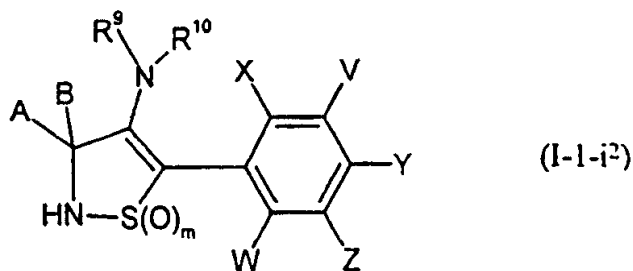
20 (O) 而且,还发现上述的式 (I-1-i) 化合物可通过下述方法获得



其中

A, B,  $R^9$ ,  $R^{10}$ ,  $R^{11}$ , V, W, X, Y, Z 和 m 定义同上,

即将式 (I-1-i<sup>2</sup>) 化合物



其中

- 5      A, B, R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup>, V, W, X, Y, Z 和 m 定义同上,  
与通式 (XIX) 的酰基氯反应



其中

- 10      R<sup>11</sup> 定义同上, 但不代表氢,  
Hal 代表卤素, 特别是氯和溴,  
如需要存在稀释剂并优选存在碱的条件下进行反应。  
另外, 已发现式 (I) 新化合物作为农药具有很好的活性, 优选作为  
杀虫剂和杀螨剂, 还可作为除草剂。
- 15      式 (I) 提供了本发明化合物的通式。上下文所提及的式中所列基  
团的优选取代基或优选范围如下所示:  
V 优选代表氢、卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧  
基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-卤代烷氧基、苯基、硝基或氰基,  
W 优选代表氢、卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧  
20 基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-卤代烷氧基、硝基或氰基,  
X 优选代表氢、卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧  
基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基亚磺酰基、  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-卤代烷氧基、硝基、氰基或各自可任意选  
择地被卤素-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷基-、C<sub>1</sub>-  
25 C<sub>4</sub>-卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的苯基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、苯氧

基、苯硫基、苄氧基或苄硫基，

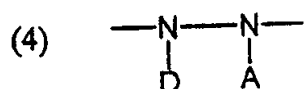
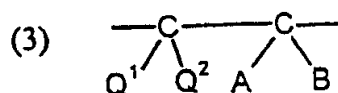
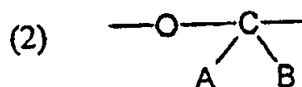
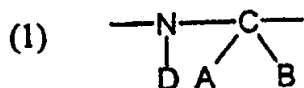
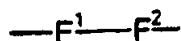
- Y 和 Z 各自独立地优选代表氢、卤素、 $C_1-C_6$ -烷基、 $C_1-C_6$ -卤代烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基、 $C_2-C_6$ -链烯基、 $C_2-C_6$ -炔基、 $C_1-C_6$ -烷硫基、 $C_1-C_6$ -烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$ -烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ -卤代烷氧基、硝基、氰基
- 5 或各自可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -烷基-、 $C_1-C_6$ -烷氧基、 $C_1-C_4$ -卤代烷基-、 $C_1-C_6$ -卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的苯基、苯基- $C_1-C_4$ -烷基、苯氧基、苯硫基、苄氧基或苄硫基，

- X 和 V 优选与它们所连接的碳原子一起代表可任意选择地被卤素-或烷基-取代的 5-或 6-元环，该环可任意选择地被一个或两个杂原子
- 10 子间断，条件是 Y 和 Z 不形成环，

Y 和 Z 优选与它们所连接的碳原子一起代表可任意选择地被卤素-或烷基-取代的 5-或 6-元环，该环可任意选择地被一个或两个杂原子间断，条件是 X 和 V 不形成环，

iii 优选代表 1 和 2，

- 15 条件是取代基 V, W, X, Y 或 Z 中至少一个基团必须不是氢， $F^1$  和  $F^2$  每个优选代表下列基团之一



- A 优选代表氢或各自可任意选择地被卤素-取代的  $C_1-C_{12}$ -烷基、 $C_3-C_8$ -链烯基、 $C_1-C_{10}$ -烷氧基- $C_1-C_8$ -烷基、二-、三-或四- $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_1-C_8$ -烷基、 $C_1-C_{10}$ -烷硫基- $C_1-C_6$ -烷基，可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -烷基-或  $C_1-C_6$ -烷氧基-取代的  $C_3-C_8$ -环烷基，其中可任意选择
- 20

地一个或两个不直接相邻的环原子被氧和/或硫替换,或代表各自可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -烷基-、 $C_1-C_6$ -卤代烷基-、 $C_1-C_6$ -烷氧基-、 $C_1-C_6$ -卤代烷氧基-、氰基-或硝基-取代的  $C_6$ -或  $C_{10}$ -芳基(苯基或萘基),含有 5-6 个环原子的杂芳基(例如呋喃基,吡啶基,咪唑基,三唑基,吡唑基,噻唑基,噻吩基)或  $C_6$ -或  $C_{10}$ -芳基- $C_1-C_6$ -烷基(苯基- $C_1-C_6$ -烷基或萘基- $C_1-C_6$ -烷基),

B 优选代表氢、 $C_1-C_{12}$ -烷基或  $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基,或

A, B 与它们所连接的碳原子优选代表饱和的  $C_3-C_{10}$ -环烷基或不饱和的  $C_5-C_{10}$ -环烷基,其中可任意选择地一个环原子被氧或硫替换并可任意选择地被  $C_1-C_8$ -烷基,  $C_3-C_{10}$ -环烷基,  $C_1-C_8$ -卤代烷基,  $C_1-C_8$ -烷氧基,  $C_1-C_8$ -烷硫基, 卤素或苯基一或二取代,或

A, B 与它们所连接的碳原子优选代表被烯二基取代的  $C_3-C_6$ -环烷基,其中该烯二基可任意选择地含有一个或两个不直接相邻的氧和/或硫原子,或优选代表被亚烷二氧基或亚烷二硫基取代的  $C_3-C_6$ -环烷基,烯二基或亚烷二氧基或亚烷二硫基与它们所连接的碳原子一起形成另一五-至八元环,或

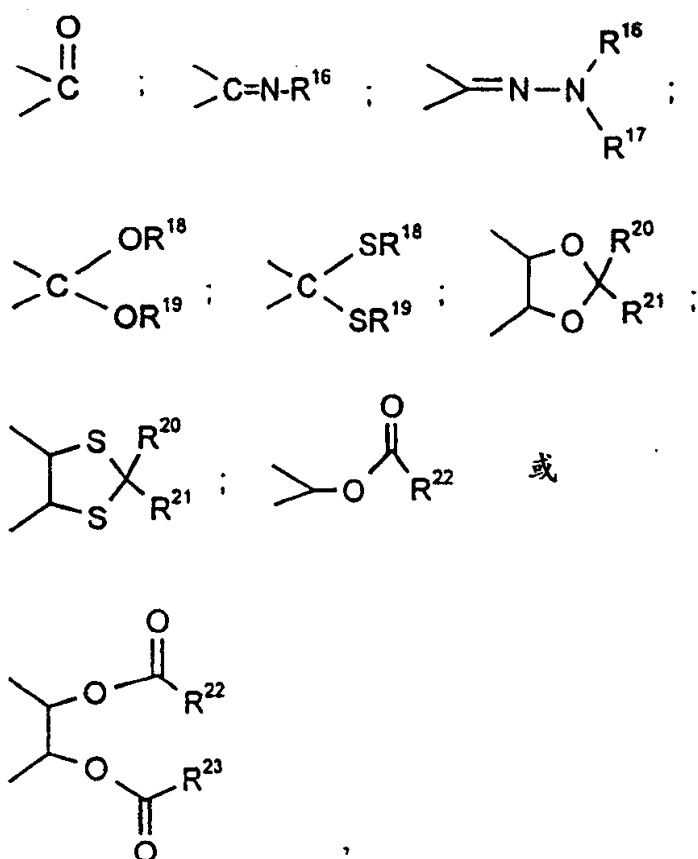
A, B 与它们所连接的碳原子优选代表  $C_3-C_8$ -环烷基或  $C_5-C_8$ -环烯基,其中两个取代基与它们所连接的碳原子一起代表各自可任意选择地被  $C_1-C_6$ -烷基-,  $C_1-C_6$ -烷氧基或卤素-取代的  $C_2-C_6$ -烷二基、 $C_2-C_6$ -烯二基或  $C_4-C_6$ -链烷二烯二基,其中可任意选择地一个亚甲基被氧或硫替换,

D 优选代表氢,各自可任意选择地被卤素-取代的  $C_1-C_{12}$ -烷基、 $C_3-C_8$ -链烯基、 $C_3-C_8$ -炔基、 $C_1-C_{10}$ -烷氧基- $C_2-C_8$ -烷基、二-,三-或四- $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_2-C_8$ -烷基、 $C_1-C_{10}$ -烷硫基- $C_2-C_8$ -烷基,可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_4$ -烷基-、 $C_1-C_4$ -烷氧基或  $C_1-C_4$ -卤代烷基-取代的  $C_3-C_8$ -环烷基,其中可任意选择地一个环原子被氧或硫替换,或代表各自可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -烷基-、 $C_1-C_6$ -卤代烷基-、 $C_1-C_6$ -烷氧基-、 $C_1-C_6$ -卤代烷氧基-、氰基-或硝基-取代的苯基,含有 5 或 6 个环原子的杂芳基(例如呋喃基,咪唑基,吡啶基,噻唑基,吡唑基,噻吩基,吡咯基,噻吩基或三唑基),苯基- $C_1-C_6$ -烷基或含有 5 或 6 个环原子的杂芳基- $C_1-C_6$ -烷基(例如呋喃基-,咪唑基-,吡啶基-,噻唑基-,吡唑基-,噻吩基-,吡咯基-,噻吩基-或三唑基- $C_1-C_6$ -烷基)或代表基

团  $\text{CO-R}^{11}$ , 或

A 和 D 一起优选代表各自可任意选择地取代的  $\text{C}_3\text{-C}_6$ -烷二基或  $\text{C}_3\text{-C}_6$ -烯二基, 其中可任意选择地一个亚甲基被羰基、氧或硫替换, 和其中取代基各自可为:

- 5 卤素、羟基、巯基或各自可任意选择地被卤素-取代的  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷硫基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ -环烷基、苯基或苄氧基, 其中可任意选择地两个相邻取代基与它们所连接的碳原子形成另外的含有 5 或 6 个环原子的饱和或不饱和环(当为结构式(I-1)化合物时, A 和 D 与它们所连接的原子一起代表, 例如下文进一步提及的基团 AD-1 至 AD-10), 该环可含有氧或硫, 或其中可任意选择地含有下列基团之一



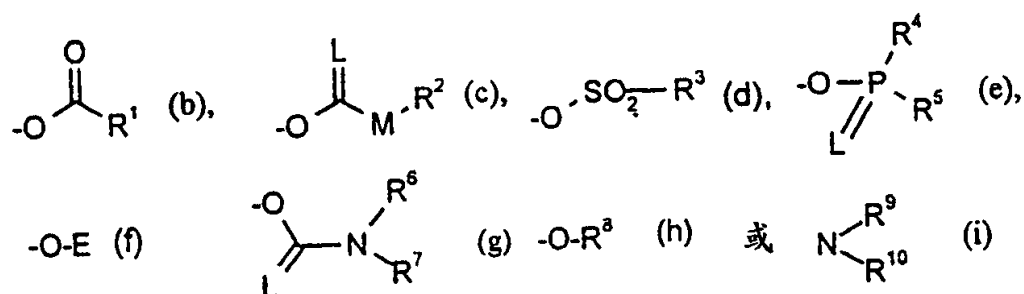
- 15 A 和  $\text{Q}^1$  一起优选代表  $\text{C}_3\text{-C}_6$ -烷二基或  $\text{C}_4\text{-C}_6$ -烯二基, 其中每个基团可任意选择地被卤素、羟基, 被  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷硫基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ -环烷基或被苄氧基或苯基相同或不同地一-或二取代, 其中  $\text{C}_{1-10}$  烷基、 $\text{C}_{1-6}$  烷氧基、 $\text{C}_{1-6}$  烷硫基、 $\text{C}_{3-7}$  环烷基各自可任意选择地被卤素相同或不同地一至三取代, 苄氧基或苯基各自可任意选择地

被卤素、C<sub>1-6</sub>烷基或C<sub>1-6</sub>烷氧基相同或不同地一至三取代，或代表可任意选择地被卤素-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的链烷二烯二基，条件是B和Q<sup>2</sup>与它们所连接的碳原子一起代表双键以及W或X中的至少一个取代基不代表氢，

5 Q<sup>1</sup> 优选代表氢、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷硫基-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-烷基，可任意选择地被C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基-或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基-取代的C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-环烷基，其中可任意选择地一个亚甲基被氧或硫替换，或代表可任意选择地被卤素-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基-、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-卤代烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-卤代烷氧基-、氰基-或硝基-取代的苯基，或

10 Q<sup>2</sup> 优选代表氢或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基，

G 优选代表羟基(a)或代表下列基团之一



15 其中

E 代表金属离子或铵离子，

L 代表氧或硫以及

M 代表氧或硫，

20 R<sup>1</sup> 优选代表各自可任意选择地被卤素-取代的C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-链烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷硫基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、多-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基或可任意选择地被卤素-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基-或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基-取代的C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-环烷基，其中可任意选择地一个或多个(优选一个或两个)不直接相邻的环原子被氧和/或硫替换，

25 代表可任意选择地被卤素-、氰基-、硝基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-卤代烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-卤代烷氧基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷硫基-或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基磺酰基-取代的苯基，

代表可任意选择地被卤素-、硝基-、氰基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-

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,

代表可任意选择地被卤素-或  $C_1-C_6$ -烷基-取代的 5-或 6-元杂芳基(例如吡唑基、噻唑基、吡啶基、嘧啶基、呋喃基或噻吩基),

- 5 代表可任意选择地被卤素-或  $C_1-C_6$ -烷基-取代的苯氧基- $C_1-C_6$ -烷基, 或

代表可任意选择地被卤素-、氨基-或  $C_1-C_6$ -烷基-取代的 5-或 6-元杂芳氧基- $C_1-C_6$ -烷基(例如吡啶氧基- $C_1-C_6$ -烷基, 嘧啶氧基- $C_1-C_6$ -烷基或噻唑氧基- $C_1-C_6$ -烷基),

- 10  $R^2$  优选代表各自可任意选择地被卤素-取代的  $C_1-C_{20}$ -烷基、 $C_2-C_{20}$ -链烯基、 $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_2-C_8$ -烷基、多- $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_2-C_8$ -烷基, 代表可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -烷基-或  $C_1-C_6$ -烷氧基-取代的  $C_3-C_8$ -环烷基, 或

- 15 代表各自可任意选择地被卤素-、氟基-、硝基-、 $C_1-C_6$ -烷基-、 $C_1-C_6$ -烷氧基-、 $C_1-C_6$ -卤代烷基-或  $C_1-C_6$ -卤代烷氧基-取代的苯基或苄基,

$R^3$  优选代表可任意选择地被卤素-取代的  $C_1-C_8$ -烷基或代表各自可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -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-、氟基-或硝基-取代的苯基或苄基,

- 20  $R^4$  和  $R^5$  各自独立地优选代表各自可任意选择地被卤素-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、 $C_2-C_8$ -链烯硫基、 $C_3-C_7$ -环烷硫基或代表各自可任意选择地被卤素-、硝基-、氟基-、 $C_1-C_4$ -烷氧基-、 $C_1-C_4$ -卤代烷氧基-、 $C_1-C_4$ -烷硫基-、 $C_1-C_4$ -卤代烷硫基-、 $C_1-C_4$ -烷基-或  $C_1-C_4$ -卤代烷基-取代的苯基、苯氧基或苯硫基,

- 25  $R^6$  和  $R^7$  各自独立地优选代表氢, 代表各自可任意选择地被卤素-取代的  $C_1-C_8$ -烷基、 $C_3-C_8$ -环烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基、 $C_3-C_8$ -链烯基、 $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_1-C_8$ -烷基, 代表可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_8$ -卤代烷基-、 $C_1-C_8$ -烷基-或  $C_1-C_8$ -烷氧基-取代的苯基, 可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_8$ -烷基-、 $C_1-C_8$ -卤代烷基-或  $C_1-C_8$ -烷氧基-取代的苄基或与它们所连接的 N 原子一起代表可任意选择地被  $C_1-C_4$ -烷基取代的  $C_3-C_6$ -链烯基, 其中可任意选择地一个碳原子被氧或硫替换,
- 30

$R^8$  优选代表各自可任意选择地被卤素取代的  $C_1-C_{10}$ -烷基、 $C_3-C_8$ -链烯基、 $C_3-C_8$ -炔基、 $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_8$ -链烯氧基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_8$ -炔氧基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_8$ -烷基羰基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基羰基- $C_1-C_4$ -烷基，代表可任意选择地被氟-、 $C_1-C_4$ -烷基-或  
5  $C_1-C_4$ -烷氧基-取代的环烷基或代表可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -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-、氟基-或硝基-取代的苯基- $C_1-C_4$ -烷基、苯基羰基- $C_1-C_4$ -烷基或苯氧基- $C_1-C_4$ -烷基，

$R^9$  优选代表氢，可任意选择地被卤素取代的  $C_1-C_{10}$ -烷基、 $C_3-C_{10}$ -链烯基、 $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_1-C_8$ -烷基、 $C_1-C_8$ -烷硫基- $C_1-C_8$ -烷基、含有  
10 3-8 个环原子的环烷基，该环烷基可被氧或硫原子间断，代表苯基、苯基- $C_1-C_6$ -烷基或苯氧基- $C_1-C_6$ -烷基或各自含有 5 或 6 个环原子的杂芳基- $C_1-C_6$ -烷基，其中环含有 1 或 2 个相同或不同的氧、氮和硫原子，每个基团可任意选择地被卤素， $C_1-C_6$ -烷基， $C_1-C_6$ -烷氧基， $C_1-C_4$ -  
15 卤代烷基， $C_1-C_4$ -卤代烷氧基，氟基或硝基相同或不同地一至三取代，或

$R^{10}$  优选代表氢、 $C_1-C_{10}$ -烷基、 $C_3-C_{10}$ -链烯基或代表基团  $CO-R^{11}$ ，或

$R^9$  和  $R^{10}$  与它们所连接的氮原子一起优选代表可任意选择地被  
20  $C_1-C_4$ -烷基取代的三至七元饱和环，其中可任意选择地一个不直接与氮原子相邻的亚甲基被氧或硫原子替换，

$R^{11}$  优选代表氢，可任意选择地被卤素取代的  $C_1-C_{10}$ -烷基、 $C_3-C_{10}$ -链烯基、 $C_1-C_{10}$ -烷氧基，可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_4$ -烷基-、 $C_1-C_4$ -  
25 烷氧基-取代的  $C_3-C_8$ -环烷基或代表可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -烷基-、 $C_1-C_6$ -卤代烷基-、 $C_1-C_6$ -烷氧基-、 $C_1-C_6$ -卤代烷氧基-、氟基-或硝基-取代的苯基、苯基- $C_1-C_6$ -烷基、苄氧基或苯氧基，

$R^{16}$  优选代表氢，代表各自可任意选择地被卤素取代的  $C_1-C_8$ -烷基或  $C_1-C_8$ -烷氧基，代表可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_4$ -烷基-或  $C_1-C_4$ -烷  
30 氧基-取代的  $C_3-C_8$ -环烷基，其中可任意选择地一个亚甲基被氧或硫替换，或代表各自可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -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-、硝基-或氟基-取代的苯基、苯基- $C_1-C_4$ -烷基或苯基- $C_1-C_4$ -烷氧基，

$R^{17}$  优选代表氢或  $C_1-C_8$ -烷基, 或

$R^{16}$  和  $R^{17}$  一起优选代表  $C_4-C_6$ -烷二基,

$R^{18}$  和  $R^{19}$  可相同或不同并优选代表  $C_1-C_6$ -烷基, 或

$R^{18}$  和  $R^{19}$  一起优选代表可任意选择地被  $C_1-C_6$ -烷基、 $C_1-C_6$ -卤代

- 5 烷基取代的或可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -烷基-、 $C_1-C_4$ -卤代烷基-、 $C_1-C_6$ -烷氧基-、 $C_1-C_4$ -卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的苯基取代的  $C_2-C_4$ -烷二基,

$R^{20}$  和  $R^{21}$  各自独立地优选代表氢, 代表可任意选择地被卤素-取代的  $C_1-C_8$ -烷基或代表可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_6$ -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-、硝基-或氰基-取代的苯基, 或

$R^{20}$  和  $R^{21}$  与它们所连接的碳原子一起代表羰基或代表可任意选择地被卤素-、 $C_1-C_4$ -烷基-或  $C_1-C_4$ -烷氧基-取代的  $C_5-C_7$ -环烷基, 其中可任意选择地一个亚甲基被氧或硫替换,

- 15  $R^{22}$  和  $R^{23}$  各自独立地优选代表  $C_1-C_{10}$ -烷基、 $C_2-C_{10}$ -链烯基、 $C_1-C_{10}$ -烷氧基、 $C_1-C_{10}$ -烷基氨基、 $C_3-C_{10}$ -链烯基氨基、二- $(C_1-C_{10}$ -烷基)氨基或二- $(C_3-C_{10}$ -链烯基)氨基。

作为优选的上述基团定义中, 卤素, 包括作为取代基例如在卤代烷基中, 代表氟、氯、溴和碘, 特别是氟和氯。

- 20 X 特别优选代表氢、氟、氯、溴、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_4$ -卤代烷基、 $C_1-C_4$ -卤代烷氧基、硝基或氰基或代表可任意选择地被氟-、氯-、溴-、 $C_1-C_4$ -烷基-、 $C_1-C_4$ -烷氧基-、 $C_1-C_2$ -卤代烷基-、 $C_1-C_2$ -卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的苯基、苯氧基或苄氧基,

- 25 V 特别优选代表氢、氟、氯、溴、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -卤代烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_4$ -卤代烷氧基、苯基、硝基或氰基,

W 特别优选代表氢、氟、氯、溴、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -卤代烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_4$ -卤代烷氧基、硝基或氰基,

- 30 Y 和 Z 各自独立地特别优选代表氢、氟、氯、溴、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -卤代烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_4$ -卤代烷氧基、氰基、硝基或代表可任意选择地被氟-、氯-、溴-、 $C_1-C_4$ -烷基-、 $C_1-C_2$ -卤代烷基-、 $C_1-C_4$ -烷氧基-、 $C_1-C_2$ -卤代烷氧基-、氰基-或硝基-取代的苯基、苯氧基或苄氧基,

X 和 V 与它们所连接的碳原子一起特别优选代表可任意选择地被氟-、氯-或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基-取代的五或六元环, 该环可任意选择地被两个不直接相邻的氧原子所间断, 条件是 Y 和 Z 不形成环,

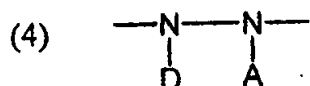
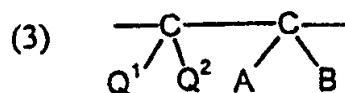
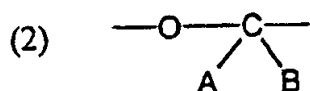
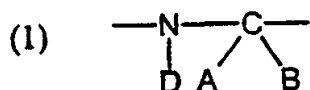
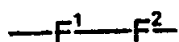
- Y 和 Z 与它们所连接的碳原子一起特别优选代表可任意选择地被  
5 氟-、氯-或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基-取代的五或六元环, 该环可任意选择地被一个或两个氧原子所间断, 条件是 X 和 V 不形成环,

iii 特别优选代表 1 和 2,

条件是取代基 V, W, X, Y 或 Z 中至少一个基团必须不是氢,

F<sup>1</sup> 和 F<sup>2</sup> 各自特别优选代表下列基团之一

10



- A 特别优选代表氢, 各自可任意选择地被氟-或氯-取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基, 可任意选择地被氟-、氯-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基-或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基-取代的 C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-环烷基, 其中可任意选择地一个  
15 环原子被氧或硫替换, 或代表苯基或苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-烷基, 其中每个基团可任意选择地被氟、氯、溴、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基或 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-卤代烷氧基、氰基或硝基一或二取代,

B 特别优选代表氢或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基, 或

- A, B 与它们所连接的碳原子特别优选代表饱和或不饱和的 C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub>-  
20 环烷基, 其中可任意选择地一个环原子被氧或硫替换以及其可任意选择地被 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基、氟、氯或苯基单取代, 或

5 A, B 与它们所连接的碳原子特别优选代表被烯二基取代的  $C_5-C_6$ -环烷基, 其中该烯二基可任意选择地含有一个或两个不直接相邻的氧或硫原子或被亚烷二氧基取代的  $C_5-C_6$ -环烷基或被亚烷二硫基 (Alkylendithiol-Gruppe) 取代的  $C_5-C_6$ -环烷基, 烯二基或亚烷二氧基或亚烷二硫基与它们所连接的碳原子一起可形成另外的五或六元环, 或

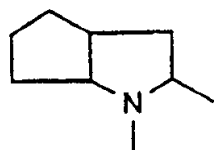
10 A, B 与它们所连接的碳原子特别优选代表  $C_3-C_6$ -环烷基或代表  $C_5-C_6$ -环烯基, 其中两个取代基与它们所连接的碳原子一起代表  $C_2-C_4$ -烷二基、 $C_2-C_4$ -烯二基, 其中可任意选择地一个亚甲基被氧或硫替换,  $C_2-C_4$ -烷二基、 $C_2-C_4$ -烯二基每个可任意选择地被  $C_1-C_5$ -烷基、 $C_1-C_5$ -烷氧基、氟、氯或溴取代或代表丁二烯二基,

15 D 特别优选代表氢, 代表各自可任意选择地被氟-或氯-取代的  $C_1-C_8$ -烷基、 $C_3-C_6$ -链烯基、 $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_2-C_4$ -烷基或  $C_1-C_6$ -烷硫基- $C_2-C_4$ -烷基, 代表可任意选择地被氟-、氯-、 $C_1-C_4$ -烷基-、 $C_1-C_4$ -烷氧基-或  $C_1-C_2$ -卤代烷基取代的  $C_3-C_7$ -环烷基, 其中可任意选择地一个亚甲基被氧或硫替换, 或代表苯基或苯基- $C_1-C_2$ -烷基, 其中每个基团可任意选择地被氟、氯、溴、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_2$ -卤代烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_2$ -卤代烷氧基、氰基或硝基一至二取代, 或代表基团  $CO-R^{11}$ ,

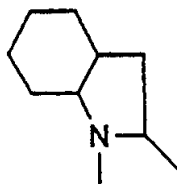
20 A 和 D 一起特别优选代表可任意选择地取代的  $C_3-C_5$ -烷二基, 其中一个亚甲基可被羰基、氧或硫替换, 其中可能的取代基为羟基、 $C_1-C_6$ -烷基或  $C_1-C_4$ -烷氧基, 或

A 和 D (在式 (I-1) 化合物的情况下) 与它们所连接的原子一起代表 AD-1 至 AD-10 中的一个基团:

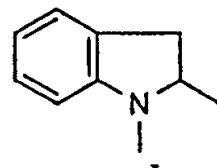
25



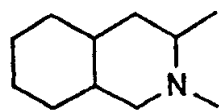
AD-1



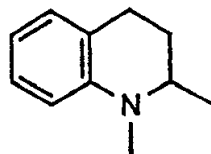
AD-2



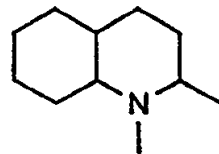
AD-3



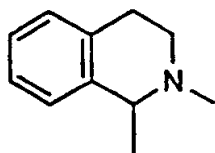
AD-4



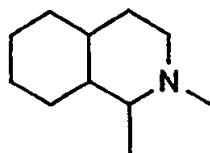
AD-5



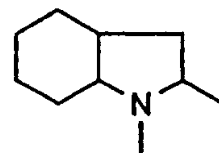
AD-6



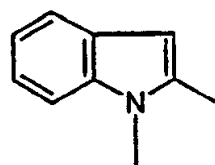
AD-7



AD-8



AD-9



AD-10

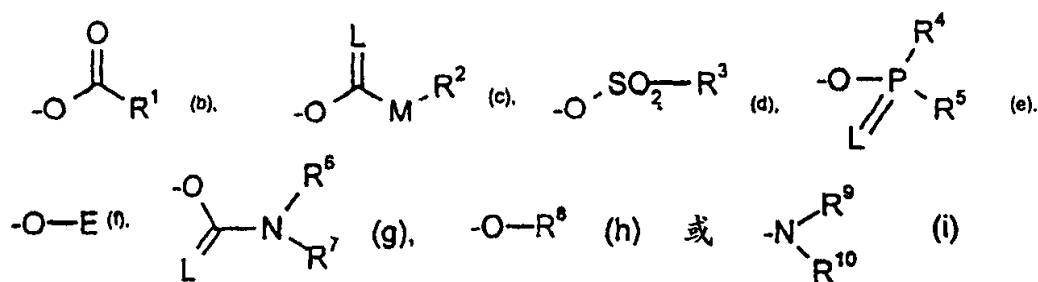
或

- A 和  $Q^1$  一起特别优选代表  $C_3-C_4$ -烷二基或  $C_3-C_4$ -烯二基, 每个基团可任意选择地被羟基, 氟, 氯, 被  $C_1-C_8$ -烷基或  $C_1-C_4$ -烷氧基相同或不同地一或二取代, 其中  $C_1-C_8$ -烷基或  $C_1-C_4$ -烷氧基可任意选择地被氟一至三取代, 或代表烷二烯二基, 该基团可任意选择地被氟、氯、溴、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_2$ -卤代烷基、 $C_1-C_2$ -卤代烷氧基、硝基或氰基一至二取代, 条件是 B 和  $Q^2$  与它们所连接的碳原子一起代表双键以及取代基 W 或 X 中至少一个不代表氢,

$Q^1$  特别优选代表氢、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_1-C_2$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷硫基- $C_1-C_2$ -烷基或可任意选择地被甲基-或甲氧基-取代的  $C_3-C_6$ -环烷基, 其中可任意选择地一个亚甲基被氧或硫替换, 或

$Q^2$  特别优选代表氢或  $C_1-C_4$ -烷基,

- G 特别优选代表羟基 (a) 或代表下列基团之一



其中

E 代表金属离子或铵离子,

5 L 代表氧或硫以及

M 代表氧或硫,

$R^1$  特别优选代表  $C_1$ - $C_{16}$ -烷基、 $C_2$ - $C_{16}$ -链烯基、 $C_1$ - $C_6$ -烷氧基- $C_1$ - $C_6$ -烷基、 $C_1$ - $C_6$ -烷硫基- $C_1$ - $C_4$ -烷基, 其中每个基团可任意选择地被氟或氯一至三取代, 或代表可任意选择地被氟-、氯-、 $C_1$ - $C_5$ -烷基-或  
10  $C_1$ - $C_5$ -烷氧基取代的  $C_3$ - $C_6$ -环烷基, 其中可任意选择地一个或两个不直接相邻的环原子被氧和/或硫替换,

代表苯基, 该苯基可任意选择地被氟、氯、溴、氰基、硝基、 $C_1$ - $C_4$ -烷基、 $C_1$ - $C_4$ -烷氧基、 $C_1$ - $C_2$ -卤代烷基、 $C_1$ - $C_2$ -卤代烷氧基、 $C_1$ - $C_2$ -烷硫基或  $C_1$ - $C_2$ -烷基磺酰基一至二取代,

15 代表苯基- $C_1$ - $C_4$ -烷基, 该苯基- $C_1$ - $C_4$ -烷基可任意选择地被氟、氯、溴、 $C_1$ - $C_4$ -烷基、 $C_1$ - $C_4$ -烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ -卤代烷基或  $C_1$ - $C_3$ -卤代烷氧基一至二取代,

代表吡唑基、噻唑基、吡啶基、嘧啶基、呋喃基或噻吩基, 各自可任意选择地被氟、氯、溴或  $C_1$ - $C_4$ -烷基一至二取代,

20  $R^2$  特别优选代表  $C_1$ - $C_{16}$ -烷基、 $C_2$ - $C_{16}$ -链烯基或  $C_1$ - $C_6$ -烷氧基- $C_2$ - $C_6$ -烷基, 其中每个基团可任意选择地被氟一至三取代,

代表苯基或苄基, 各自可任意选择地被氟、氯、溴、氰基、硝基、 $C_1$ - $C_4$ -烷基、 $C_1$ - $C_3$ -烷氧基、 $C_1$ - $C_2$ -卤代烷基或  $C_1$ - $C_2$ -卤代烷氧基一至二取代,

25  $R^3$  特别优选代表可任意选择地被氟一至三取代的  $C_1$ - $C_6$ -烷基, 或代表苯基, 该苯基可任意选择地被氟、氯、溴、 $C_1$ - $C_4$ -烷基、 $C_1$ - $C_4$ -烷氧基、 $C_1$ - $C_2$ -卤代烷基、 $C_1$ - $C_2$ -卤代烷氧基、氰基或硝基一至二取代,

$R^4$  和  $R^5$  各自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- $(C_1-C_6$ -烷基)氨基、 $C_1-C_6$ -烷硫基、 $C_3-C_4$ -烯硫基、 $C_3-C_6$ -环烷硫基或代表苯基、苯氧基或苯硫基,其各自可任意选择地被氟、氯、溴、硝基、氰基、 $C_1-C_3$ -烷氧基、 $C_1-C_3$ -卤代烷氧基、 $C_1-C_3$ -烷基或  $C_1-C_3$ -卤代烷基一至二取代,

$R^6$  特别优选代表  $C_1-C_6$ -烷基、 $C_3-C_6$ -环烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基、 $C_3-C_6$ -链烯基、 $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基,代表苯基,该苯基可任意选择地被氟、氯、溴、 $C_1-C_3$ -卤代烷基、 $C_1-C_4$ -烷基或  $C_1-C_4$ -烷氧基一至二取代,代表苄基,该苄基可任意选择地被氟、氯、溴、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_3$ -卤代烷基或  $C_1-C_4$ -烷氧基一至二取代,

$R^7$  特别优选代表氢、 $C_1-C_6$ -烷基或  $C_3-C_6$ -链烯基,

$R^6$  和  $R^7$  与它们所连接的氮原子一起特别优选代表五或六元环,其中可任意选择地与氮原子不直接相邻的一个亚甲基被氧或硫原子替换以及该环可任意选择地被甲基或乙基一至二取代,

$R^8$  特别优选代表  $C_1-C_6$ -烷基、 $C_3-C_6$ -链烯基、 $C_3-C_6$ -炔基、 $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_1-C_2$ -烷基、 $C_3-C_6$ -烯氧基- $C_1-C_2$ -烷基、 $C_3-C_8$ -炔氧基- $C_1-C_2$ -烷基、 $C_1-C_6$ -烷基羰基- $C_1-C_2$ -烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基羰基- $C_1-C_2$ -烷基,各自可任意选择地被氟或氯一至三取代,或代表苯基- $C_1-C_2$ -烷基、苯基羰基- $C_1-C_4$ -烷基或苯氧基- $C_1-C_2$ -烷基,各自可任意选择地被氟、氯、溴、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_2$ -卤代烷基、 $C_1-C_2$ -卤代烷氧基、氰基或硝基一至二取代,

$R^9$  特别优选代表氢,代表  $C_1-C_6$ -烷基、 $C_3-C_6$ -链烯基或  $C_3-C_6$ -环烷基,各自可任意选择地被氟或氯一至三取代,代表苯基- $C_1-C_2$ -烷基或吡啶基- $C_1-C_2$ -烷基,各自可任意选择地被氟、氯、溴、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_2$ -卤代烷基、 $C_1-C_2$ -卤代烷氧基、氰基或硝基一至二取代,

$R^{10}$  特别优选代表氢、 $C_1-C_6$ -烷基、 $C_3-C_6$ -链烯基或代表基团  $CO-R^{11}$ ,或

$R^9$  和  $R^{10}$  与它们所连接的氮原子一起特别优选代表五或六元饱和环,其中可任意选择地与氮原子不直接相邻的一个亚甲基被氧或硫原子替换以及该环可任意选择地被甲基或乙基一至二取代,

$R^{11}$  特别优选代表氢,代表  $C_1-C_6$ -烷基、 $C_3-C_6$ -链烯基、 $C_1-C_6$ -烷氧

基,各自可任意选择地被氟或氯一至三取代,代表  $C_3-C_6$ -环烷基,该  $C_3-C_6$ -环烷基可任意选择地被氟、氯、甲基、乙基、甲氧基或乙氧基一至二取代,或代表苯基,该苯基可任意选择地被氟、氯、溴、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_2$ -卤代烷基、 $C_1-C_2$ -卤代烷氧基、氰基或硝基一至二取代。

5

作为特别优选的上述基团定义中,卤素,包括作为取代基例如在卤代烷基中的卤素,代表氟、氯、溴和碘,特别是氟,氯和溴,特别优选氟或氯。

V 更特别优选代表氢、氟、氯、溴、硝基、甲基、苯基、甲氧基或三氟甲基,

10

W 更特别优选代表氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基,

15

X 更特别优选代表氢、溴、氟、氯、甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、三氟甲基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、硝基或氰基,

或代表苯基、苯氧基或苄氧基,各自可任意选择地被氟、氯、溴、甲基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、硝基或氰基一至二取代,

20

Y 更特别优选代表氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、二氟甲基、甲氧基、乙氧基、异丙氧基、三氟甲氧基、二氟甲氧基、氰基、硝基或代表苯基,该苯基可任意选择地被氟、氯、溴、甲基、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、氰基或硝基一至二取代,

25

Z 更特别优选代表氢、氟、氯、溴、甲基、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、氰基、硝基或代表苯基,该苯基可任意选择地被氟、氯、溴、甲基、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、氰基或硝基一至二取代,

X 和 V 与它们所连接的碳原子一起更特别优选代表可任意选择地被氟-或甲基-取代的五或六元环,且该五或六元环被两个不直接相邻的氧原子间断,条件是 Y 和 Z 不形成环,

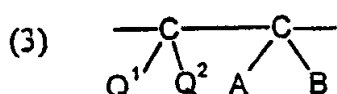
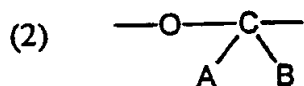
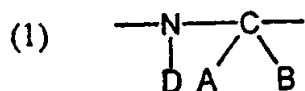
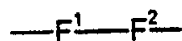
30

Y 和 Z 与它们所连接的碳原子一起更特别优选代表可任意选择地被氟-或甲基-取代的五或六元环,且该五或六元环可被一个或两个不直接相邻的氧原子间断,条件是 X 和 V 不形成环,

m 更特别优选代表 2,条件是取代基 V, W, X, Y 或 Z 中至少一个基

团必须不是氢,

$F^1$  和  $F^2$  各自更特别优选代表下列基团之一



- 5 A 更特别优选代表氢,各自可任意选择地被氟取代的  $C_1-C_6$ -烷基,可任意选择地被氟-、甲基-或甲氧基-取代的  $C_3-C_6$ -环烷基或代表苯基或苄基,其各自可任意选择地被氟、氯、溴、甲基、异丙基、叔丁基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或硝基一至二取代,

B 更特别优选代表氢或  $C_1-C_4$ -烷基,或

- 10 A, B 与它们所连接的碳原子更特别优选代表饱和的  $C_5-C_6$ -环烷基,其中可任意选择地一个环原子被氧或硫替换并且该  $C_5-C_6$  环烷基可任意选择地被甲基、乙基、正丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、氟或氯一取代,或

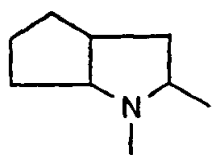
- 15 A, B 与它们所连接的碳原子更特别优选代表  $C_5-C_6$ -环烷基,其中两个取代基与它们连接的碳原子一起代表  $C_2-C_4$ -烷二基或  $C_2-C_4$ -烯二基,其中各自可任意选择地一个亚甲基被氧或硫替换,或代表丁二烯二基,

- 20 D 更特别优选代表氢,代表各自可任意选择地被氟-或氯-取代的  $C_1-C_6$ -烷基、 $C_3-C_4$ -链烯基、 $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_2-C_3$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷硫基- $C_2$ -烷基或  $C_3-C_6$ -环烷基,其中可任意选择地一个亚甲基被氧或硫替换,或代表苯基或苄基,其各自可任意选择地被氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或硝基一至二取代(当为式(I-1)化合物时,优选代表氢),
- 25 或代表基团  $CO-R^{11}$ ,

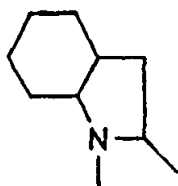
或

A 和 D 一起更特别优选代表可任意选择地取代的  $C_3-C_4$ -烷二基, 其中可任意选择地一个碳原子被硫替换并且其可任意选择地被甲基取代, 或

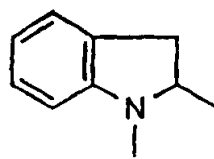
- 5 A 和 D(在式(I-1)化合物的情况下)与它们所连接的原子一起代表基团 AD-1 至 AD-10 之一:



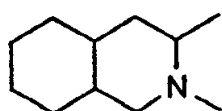
AD-1



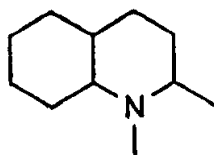
AD-2



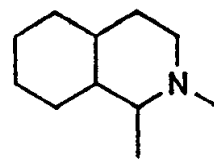
AD-3



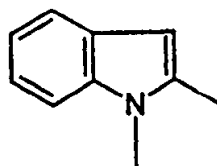
AD-4



AD-6



AD-8



AD-10

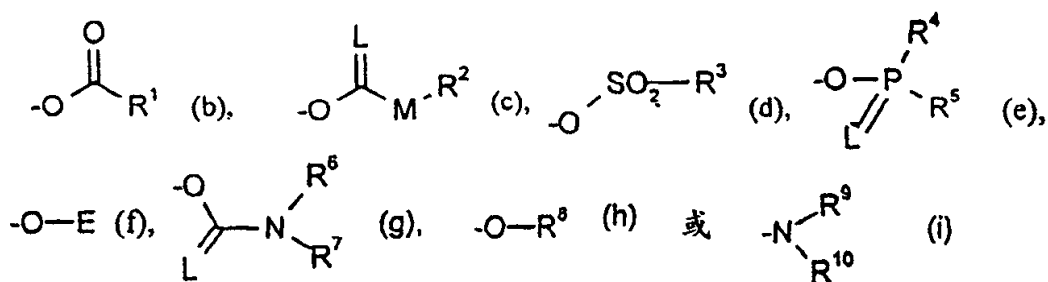
或

- 10 A 和  $Q^1$  一起更特别优选代表  $C_3-C_4$ -烷二基或丁烯二基, 基各自可任意选择地被氟、氯、羟基、甲基或甲氧基一至二取代, 或代表烷二烯二基, 该烷二烯二基可任意选择地被氟、氯、溴、甲基、甲氧基、三氟甲氧基、氰基或硝基一至二取代, 条件是 B 和  $Q^2$  与它们所连接的碳原子一起代表双键以及取代基 W 或 X 中至少一个不代表氢,

- 15  $Q^1$  更特别优选代表氢、甲基、环丙基、环戊基或环己基,

$Q^2$  更特别优选代表氢和甲基,

G 更特别优选代表羟基(a)或代表下列基团之一



特别是代表 (a), (b), (c), (g), (h) 或 (i)

其中

5 E 代表金属离子或铵离子,

L 代表氧或硫以及

M 代表氧或硫,

R<sup>1</sup> 更特别优选代表 C<sub>1</sub>-C<sub>14</sub>-烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>14</sub>-链烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基-  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷硫基-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-烷基, 其各自可任意选择地被氟或氯  
 10 一至三取代, 或代表 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烷基, 其中可任意选择地一个或两个不  
 直接相邻的环原子被氧替换以及其可任意选择地被氟、氯、甲基、乙  
 基、异丙基、异丁基、叔丁基、甲氧基、乙氧基或异丙氧基一至二取  
 代,

代表苯基, 该苯基可任意选择地被氟、氯、溴、氰基、硝基、甲  
 15 基、乙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、三氟甲基或三氟甲氧基一至二  
 取代,

代表呋喃基、噻吩基或吡啶基, 其各自可任意选择地被氟、氯、  
 溴、甲基或乙基一至二取代,

R<sup>2</sup> 更特别优选代表 C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-链烯基或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基  
 20 -C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-烷基, 其各自可任意选择地被氟一至三取代,

或代表苯基或苄基, 其各自可任意选择地被氟、氯、氰基、硝基、  
 甲基、乙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、三氟甲基或三氟甲氧基一至  
 二取代,

R<sup>3</sup> 更特别优选代表甲基、乙基、正丙基、异丙基, 其各自可任意  
 25 选择地被氟一至三取代, 或代表苯基, 该苯基各自可任意选择地被  
 氟、氯、溴、甲基、叔丁基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基  
 或硝基一取代,

$R^4$  和  $R^5$  各自独立地更特别优选代表  $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_4$ -烷基氨基、二- $(C_1-C_4$ -烷基)氨基、 $C_1-C_4$ -烷硫基或代表苯基、苯氧基或苯硫基,其各自可任意选择地被氟、氯、溴、甲基、硝基、氰基、甲氧基、三氟甲氧基或三氟甲基一至二取代,

5  $R^6$  更特别优选代表  $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_6$ -环烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_3-C_4$ -链烯基、 $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基,代表苯基,该苯基可任意选择地被氟、氯、溴、三氟甲基、甲基或甲氧基一至二取代,代表苄基,该苄基可任意选择地被氟、氯、溴、甲基、三氟甲基或甲氧基一至二取代,

10  $R^7$  更特别优选代表氢、 $C_1-C_4$ -烷基或  $C_3-C_4$ -链烯基,

$R^6$  和  $R^7$  与它们所连接的氮原子一起更特别优选代表五或六元环,其中可任意选择地与氮原子不直接相邻的一个亚甲基可被氧或硫原子替换并且该环可任意选择地被甲基一至二取代,

15  $R^8$  更特别优选代表  $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_4$ -链烯基、 $C_1-C_4$ -烷氧基-甲基、 $C_3-C_4$ -烯氧基-甲基、 $C_3-C_4$ -炔氧基-甲基、 $C_1-C_4$ -烷基羰基-甲基、 $C_1-C_4$ -烷氧基羰基-甲基,其各自可任意选择地被氟或氯一至三取代,或代表苄基、苯基羰基-甲基或苯氧基-甲基,其各自可任意选择地被氟、氯、溴、甲基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或硝基一至二取代,

20  $R^9$  更特别优选代表氢,代表  $C_1-C_4$ -烷基、烯丙基、环丙基、环戊基、环己基,其各自可任意选择地被氟或氯一至三取代,代表苄基,该苄基可任意选择地被氟、氯、溴、甲基、乙基、异丙基、叔丁基、甲氧基、异丙氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或硝基一至二取代,

25  $R^{10}$  更特别优选代表氢、 $C_1-C_4$ -烷基、烯丙基或代表基团  $CO-R^{11}$ ,  
或

$R^9$  和  $R^{10}$  与它们所连接的氮原子一起更特别优选代表饱和的五至六元环,其中可任意选择地与氮原子不直接相邻的一个亚甲基被氧或硫原子替换并且该环可任意选择地被甲基一至二取代,

30  $R^{11}$  更特别优选代表氢,代表  $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_4$ -链烯基、 $C_1-C_4$ -烷氧基,其各自可任意选择地被氟或氯一至三取代,代表环丙基、环戊基或环己基,其各自可任意选择地被氟、氯、甲基或甲氧基一取代,或代表苯基,该苯基可任意选择地被氟、氯、溴、甲基、甲氧基、三氟甲

基、三氟甲氧基、氰基或硝基一至二取代。

特别优选的式(I)化合物如下, 其中

V 代表氢、氟、氯、溴、甲基、三氟甲基、硝基或苯基,

W 代表氢、氟、氯、溴、甲基、乙基,

5 X 代表氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、甲氧基、三氟甲基或硝基、氰基,

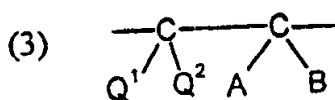
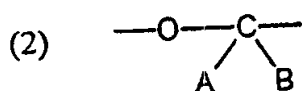
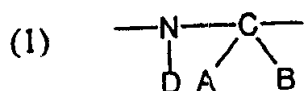
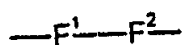
Y 代表氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、异丙基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、异丙氧基、二氟甲基、三氟甲基、三氟甲氧基、二氟甲氧基或苯基,

10 Z 代表氢、氟、氯、溴、甲基、三氟甲基,

Y 和 Z 与它们所连接的碳原子一起形成五元环, 该五元环可被一个或两个不直接相邻的氧原子间断, 条件是 X 和 V 不形成环,

m 代表 2, 条件是取代基 V, W, X, Y 或 Z 中至少一个基团必须不是氢,

15  $F^1$  和  $F^2$  代表下列基团之一



其中

A 代表氢、 $C_1-C_4$ -烷基, 代表苯基或苄基, 该苯基或苄基可任意选  
20 择地被氯或氟一至二取代,

B 代表氢或  $C_1-C_4$ -烷基,

A 和 B 与它们所连接的碳原子代表饱和的环己基, 其中可任意选  
择地一个环原子被氧替换以及其可任意选择地被甲基、乙基、正丙  
基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、

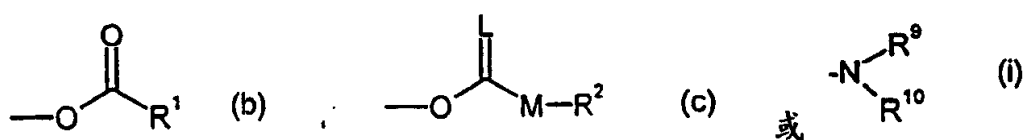
25 乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、氟或氯一取代,

D 代表氢、 $C_1$ - $C_4$ -烷基,代表苯基或苄基,该苯基或苄基可任意选择地被氯、氟、溴一至二取代,或代表基团  $CO-R^{11}$ ,

A 和  $Q^1$  一起代表  $C_3$ - $C_4$ -烷二基或丁烯二基,其可任意选择地被甲基、氟或氯一至二取代,或代表可任意选择地被甲基或氯一至二取代的烷二烯二基,

条件是 B 和  $Q^2$  与它们所连接的碳原子一起代表双键以及取代基 W 或 X 中至少一个基团不代表氢,

G 代表羟基 (a) 或代表



$R^1$  代表  $C_1$ - $C_8$ -烷基,

$R^2$  代表  $C_1$ - $C_8$ -烷基,

L 和 M 代表氧,

$R^9$  代表氢,

$R^{10}$  代表氢或代表基团  $CO-R^{11}$ ,

$R^{11}$  代表  $C_1$ - $C_4$ -烷基.

特别优选式 (I-1) 化合物, 其中 D 代表氢, 其中取代基 G 代表基团 (a), (b), (g), (h) 或 (i) 以及其中 A, B, V, W, X, Y, Z,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$  和 m 代表在更特别优选范围内所给出的定义.

特别优选式 (I-2) 化合物, 其中 D 代表氢, 其中取代基 G 代表基团 (a), (b), (g), (h) 或 (i) 以及其中 A, B, V, W, X, Y, Z,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$  和 m 代表在更特别优选范围内所给出的定义.

特别优选式 (I-3) 化合物, 其中 D 代表氢, 其中取代基 A 和  $Q^1$  代表可任意选择取代的烷二烯二基, 其中, 可能的取代基为在特别优选范围内提及的那些基团, 其中取代基 G 代表基团 (a), (b), (g), (h) 或 (i) 以及其中 B,  $Q^2$ , V, W, X, Y, Z,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$  和 m 代表在更特别优选范围内所给出的定义.

上述一般或优选基团定义或解释可互相, 即包括各自所给范围与优选范围之间任意地组合. 它们既适用于终产物, 也相应地适用于前

体和中间体。

本发明优选具有上述优选定义组合的那些式(I)化合物。

本发明特别优选具有上述特别优选定义组合的那些式(I)化合物。

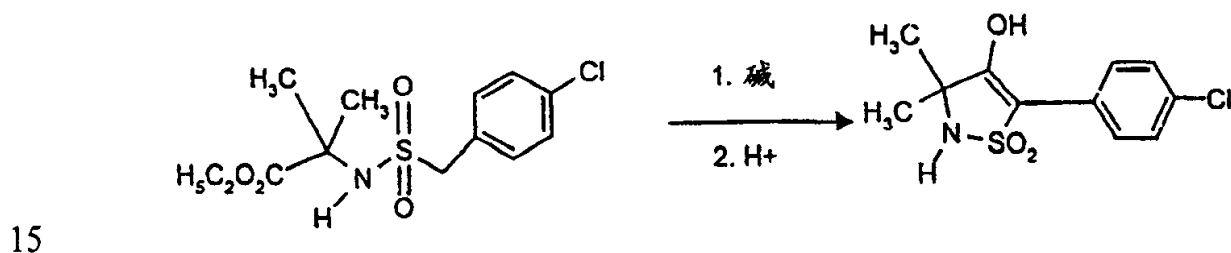
5 本发明更特别优选具有上述更特别优选定义组合的那些式(I)化合物。

特别优选其中 G 代表氢的式(I)化合物。

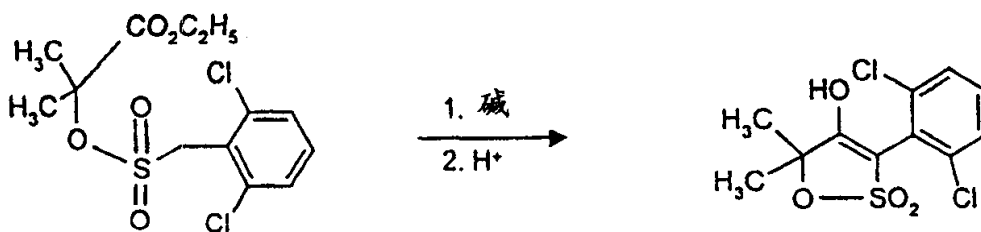
饱和或不饱和的烃基如烷基或链烯基,如可能各自可为直链或支链,包括与杂原子连接,如在烷氧基中。

10 除非另有说明,可任意任意选择地被取代的基团可被一或多取代,其中在多取代的情况下取代基可以相同或不同。

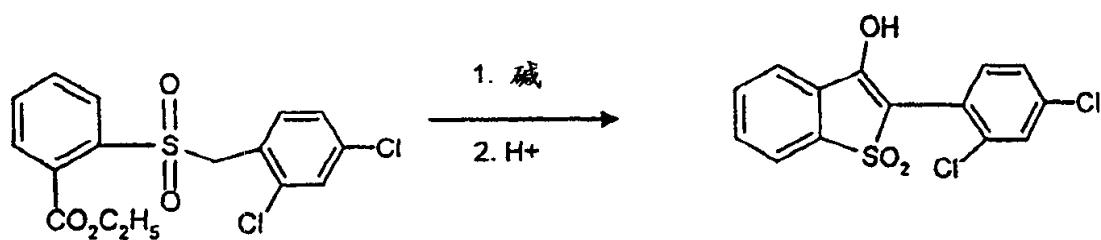
如果根据方法(A),使用 2{[(4-氯苄基)磺酰基]氧基}-2-甲基丙酸乙酯作为起始物,则本发明方法可用下述反应路线表示:



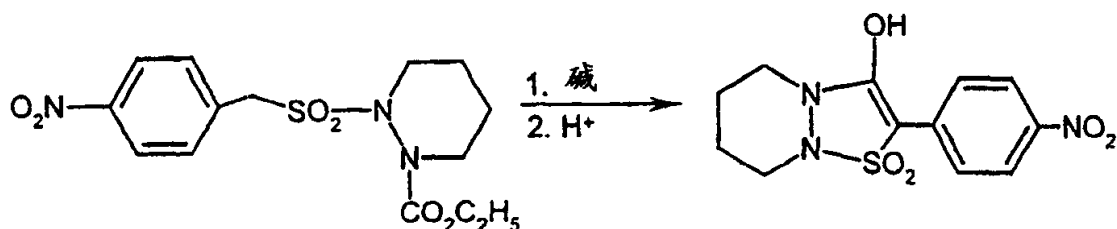
如果根据方法(B),使用 2-[(2,6-二氯苄基)磺酰基]氧基}-2-甲基丙酸乙酯,则本发明方法可用下述反应路线表示:



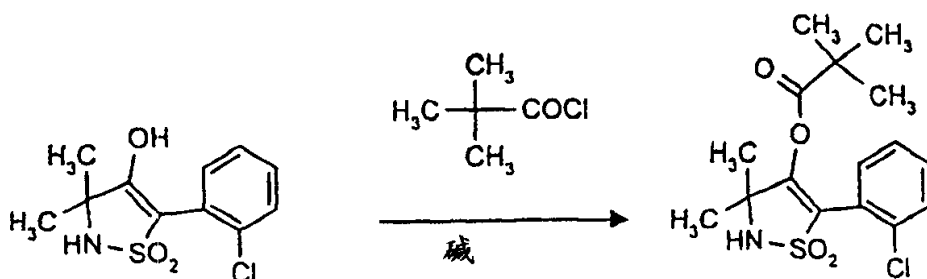
20 如果根据方法(C),使用 2-[(2,4-二氯苄基)磺酰基]苯甲酸乙酯,则本发明方法可用下述反应路线表示:



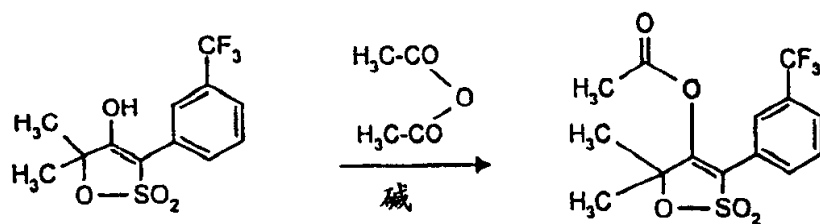
如果根据方法(D), 例如使用 2-[(4-硝基苄基)磺酰基]-四氢-1(2H)-吡嗪羧酸乙酯作为起始物, 则本发明方法可用下述反应路线表示:



根据方法(E, 变换方法 $\alpha$ ), 使用 5-(2-氯苄基)-4-羟基-3,3-二甲基-2,3-二氢-1H-1-异噻唑-1,1-二酮和新戊酰氯作为起始物, 则本发明方法可用下述反应路线表示:

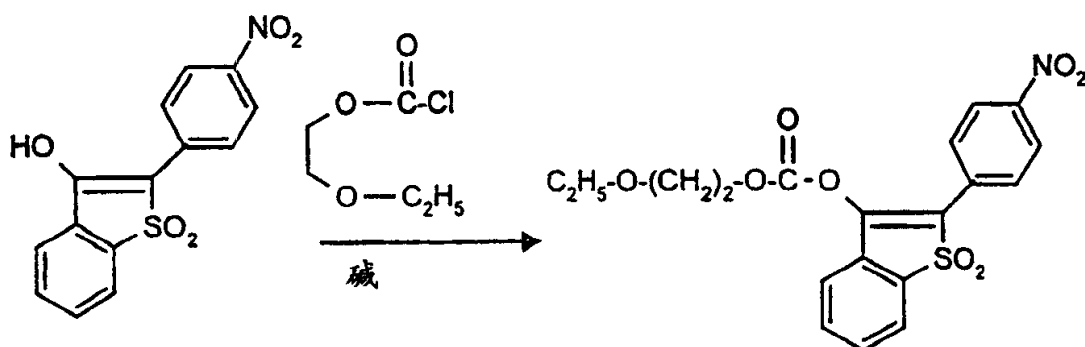


根据方法(E, 变换方法 $\beta$ ), 使用 4-羟基-5,5-二甲基-3-[3-(三氟甲基)苄基]-1,2[ $\lambda$ ]<sup>6</sup>-氧杂硫杂环戊烯(oxathiol)-2,2(5H)-二酮和乙酸酐作为起始物, 则本发明方法可用下述反应路线表示:



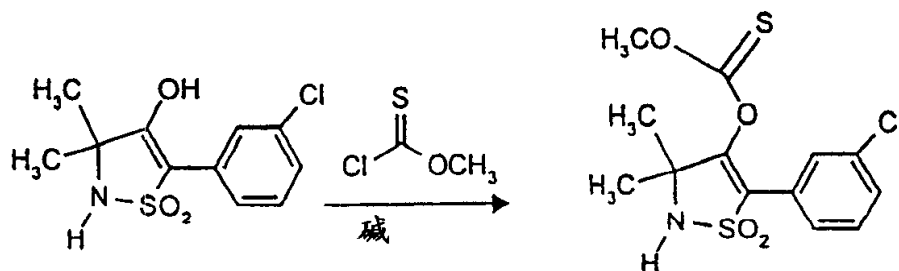
如果根据方法(F), 使用 3-羟基-2-(4-硝基苯基)-1H-1-苯并噻吩-1,1-二酮和氯甲酸乙氧乙酯作为起始物, 则本发明方法可用下述

5 反应路线表示:



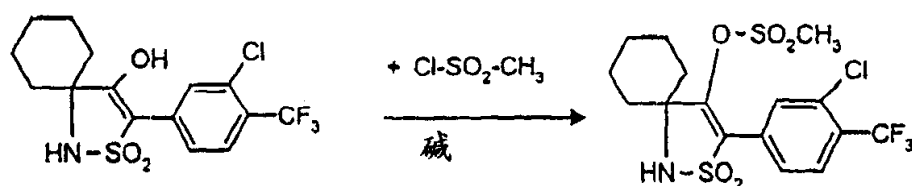
如果根据方法(G), 使用 5-(3-氯苯基)-4-羟基-3,3-二甲基-2,3-二氢-1H-1-异噻唑-1,1-二酮和氯一硫代甲酸甲酯作为起始物,

10 则反应路线表示如下:

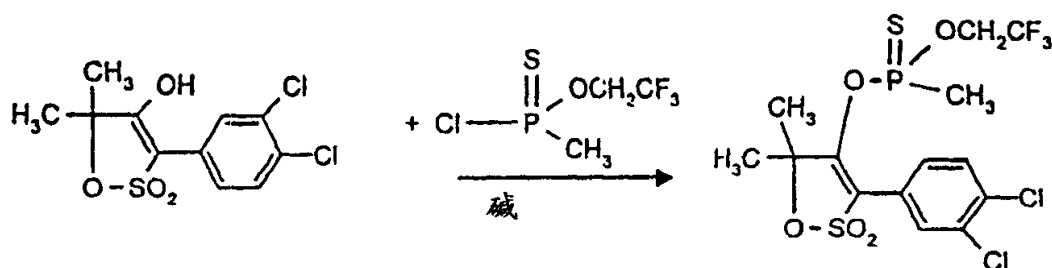


如果根据方法(H), 使用 3-[3-氯-4-三氟甲基)苯基]-4-羟基-2-硫杂-1-氮杂螺[4.5]癸-3,4-烯-2,2-二酮和甲磺酰氯作为起始物,

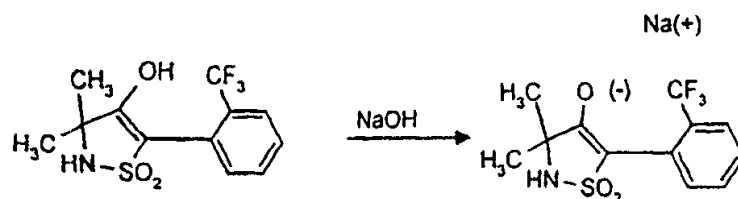
15 则本发明方法可用下述反应路线表示:



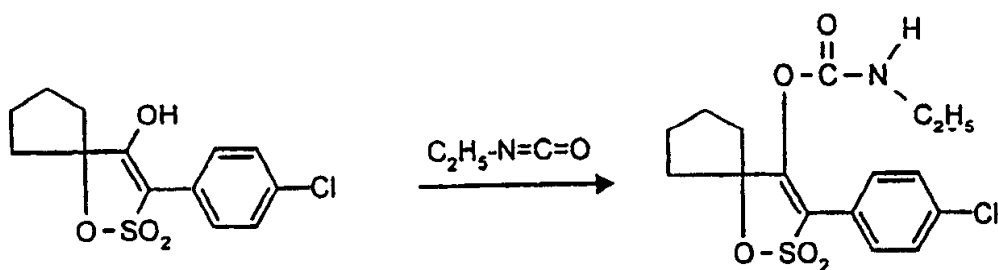
如果根据方法(I), 使用 3-[3,4-二氯苯基]-4-羟基-5,5-二甲基-1,2-氧杂硫杂环戊烯-2,2(5H)-二酮和甲硫磷酰氯-(2,2,2-三氟乙酯)作为起始物, 则本发明方法可用下述反应路线表示:



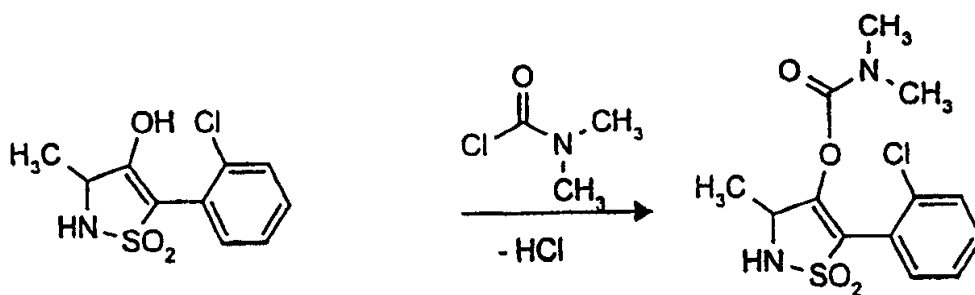
如果根据方法(J), 使用 4-羟基-3,3-二甲基-5-[2-(三氟甲基)-苯基]-2,3-二氢-1H-1-异噻唑-1,1-二酮和 NaOH 作为组分, 则本发明方法可用下述反应路线表示:



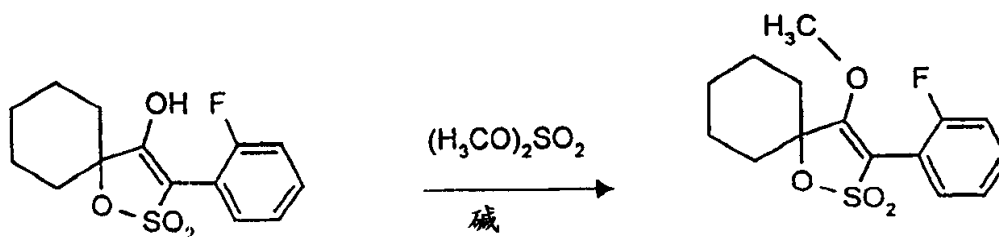
如果根据方法(K, 变换方法 $\alpha$ ), 使用 3-(4-氯苯基)-4-羟基-1-氧杂-2-硫杂螺[4.4]壬-3,4-烯-2,2-二酮和异氰酸乙酯作为起始物, 则该方法可用下述反应路线表示:



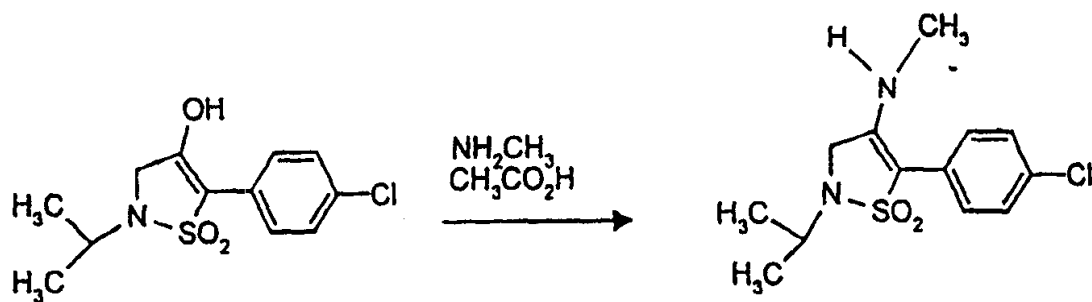
如果根据方法(K, 变换方法 $\beta$ ), 使用 5-(2-氯苯基)-4-羟基-3-甲基-2, 3-二氢-1H-1-异噻唑-1, 1-二酮和二甲基氨基甲酰氯作为起始物, 该方法可用下述反应路线表示:



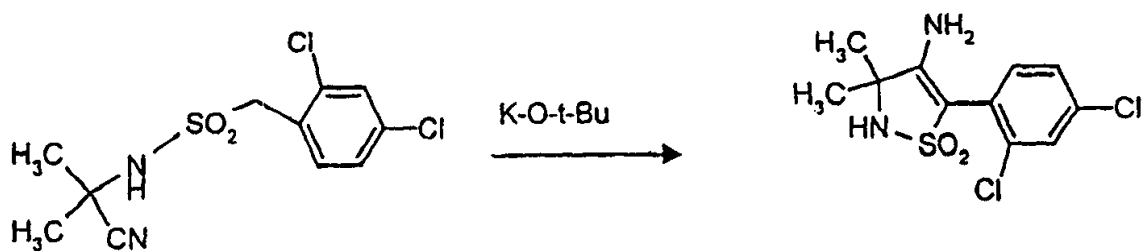
如果根据方法(L), 使用 3-(2-氟苯基)-4-羟基-1-氧杂-2-硫杂螺[4.5]癸-3, 4-烯-2, 2-二酮和硫酸二甲酯作为起始物, 则该方法可用下述反应路线表示:



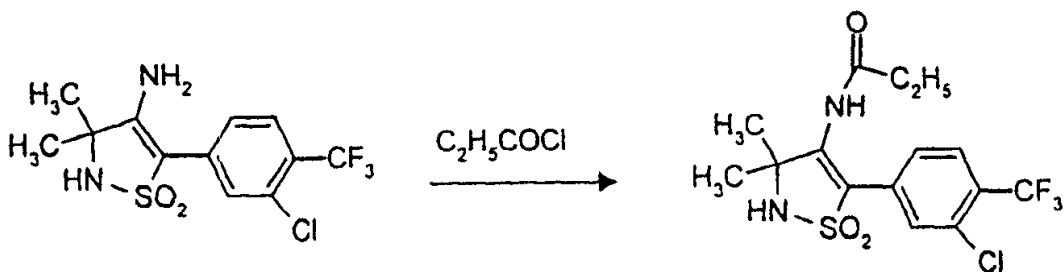
如果根据方法(M, 变换方法 $\alpha$ ), 使用 5-(4-氯苯基)-4-羟基-2-异丙基-2, 3-二氢-1H-1-异噻唑-1, 1-二酮, 甲胺和乙酸作为起始物, 本发明方法的反应过程可用下述反应路线表示:



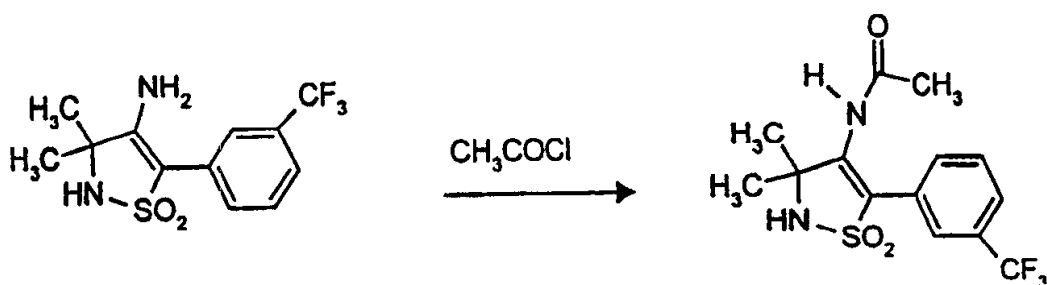
如果根据方法(M, 变换方法 $\beta$ ), 使用 N-(1-氟基-1-甲基乙基)-(2, 4-二氯苯基) 甲基氨磺酰和叔丁醇钾作为起始物, 则本发明方法的  
5 反应过程可用下述反应路线表示:



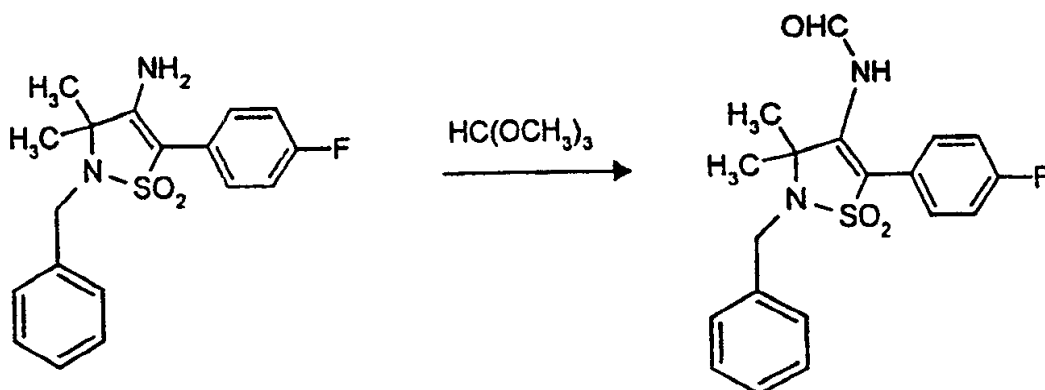
如果根据方法(N, 变换方法 $\alpha$ ), 使用 4-氨基-5-[3-氯-4-(三氟甲基)苯基]-3, 3-二甲基-2, 3-二氢-1H-1-异噻唑-1, 1-二酮和丙酰氯  
10 作为起始物, 则本发明方法的反应过程可用下述反应路线表示:



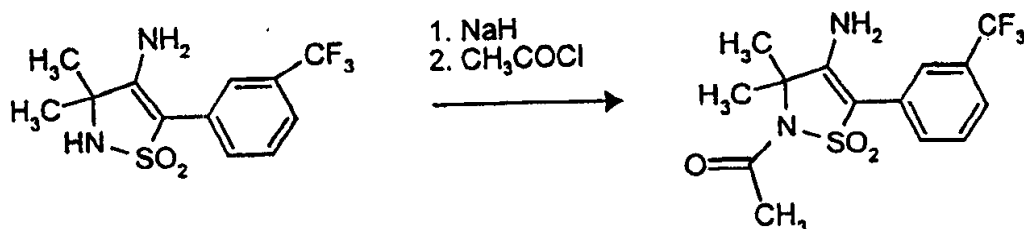
如果根据方法(N, 变换方法 $\beta$ ), 使用 4-氨基-3, 3-二甲基-5-[3-(三氟甲基)苯基]-2, 3-二氢-1H-1-异噻唑-1, 1-二酮和乙酸酐作为  
15 起始物, 则本发明方法的反应过程可用下述反应路线表示:



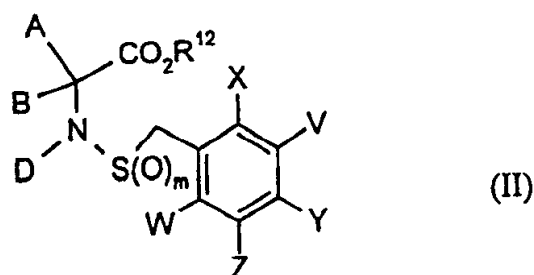
如果根据方法(N, 变换方法 $\gamma$ ), 使用 4-氨基-2-苄基-5-(4-氟苯基)-3,3-二甲基-2,3-二氢-1H-1-异噻唑-1,1-二酮和原甲酸甲酯作为起始物, 则本发明方法的反应过程可用下述反应路线表示:



如果根据方法(0), 起始物使用 4-氨基-3,3-二甲基-5-[3-(三氟甲基)苯基]-2,3-二氢-1H-1-异噻唑-1,1-二酮和乙酰氯以及碱使用氢氧化钠, 则本发明方法的反应过程可用下述反应路线表示:



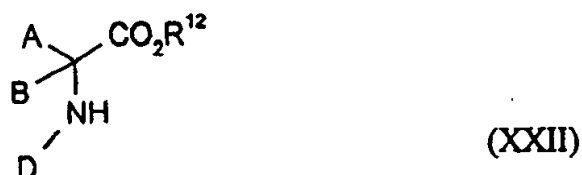
在本发明方法(A)中作为起始物所需的式(II)化合物是新的



其中

A, B, D, V, W, X, Y, Z, R<sup>12</sup> 和 m 如上所述定义.

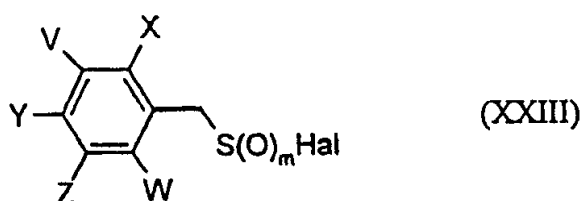
5 例如, 当式 (XXII) 的氨基酸衍生物



其中

A, B, R<sup>12</sup> 和 D 如上所述定义

10 与式 (XXIII) 的取代的苄基-S(O)<sub>m</sub> 卤化物反应



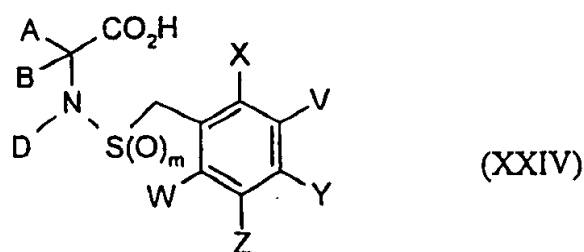
其中

V, W, X, Y, Z 和 m 如上所述定义以及

15 Hal 代表氯或溴, 特别是氯

(H. -D. Stachel, G. Drasch, Arch. Pharm. 318, 304 (1985)),

或将式 (XXIV) 的氨基酸酯化



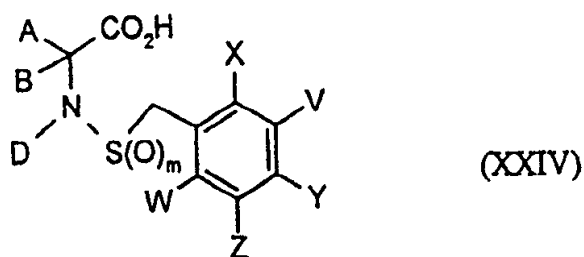
其中

A, B, D, V, W, X, Y, Z 和 m 如上所述定义

5 (Chem. Ind. (London) 1568 (1968))

可获得式 (II) 的氨基酸酯。

式 (XXIV) 化合物是新的



10 其中

A, B, D, V, W, X, Y, Z 和 m 如上所述定义。

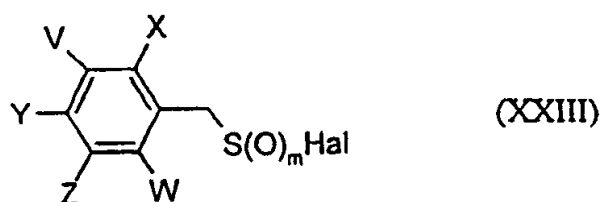
将式 (XXV) 的氨基酸



15 其中

A, B 和 D 如上所述定义

用式 (XXIII) 的取代的苄基-S(O)m 卤化物酰化



其中

V, W, X, Y, Z 和 m 如上所述定义以及

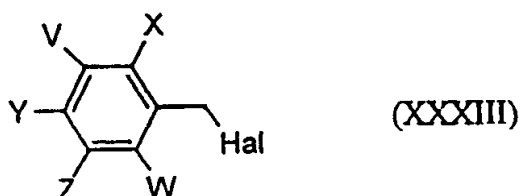
5 Hal 代表氯或溴, 特别是氯,

可获得式 (XXIV) 化合物,

例如根据 Schotten-Baumann (Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, 第 505 页)。

10 某些式 (XXIII) 化合物是新的。通常它们可通过原则上已知的方法制备。

可通过下述方法获得式 (XXIII) 化合物, 其中 V, W, X, Y 和 Z 如上所述定义以及 m 代表 2, 例如将式 (XXXIII) 的取代的苄基卤化物

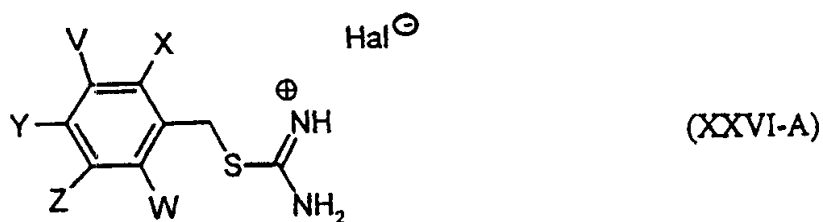


15 其中

V, W, X, Y 和 Z 如上所述定义以及

Hal 代表氯或溴

用硫脲转化为式 (XXVI-A) 的异硫脲鎓盐



20

其中

A 10x10 grid of dots forming the letters 'U', 'C', 'I', and 'E'. The 'U' is formed by dots at (row, col) coordinates: (1,1), (1,2), (1,3), (1,4), (1,5), (1,6), (1,7), (1,8), (1,9), (1,10), (2,1), (2,2), (2,3), (2,4), (2,5), (2,6), (2,7), (2,8), (2,9), (2,10), (3,1), (3,2), (3,3), (3,4), (3,5), (3,6), (3,7), (3,8), (3,9), (3,10), (4,1), (4,2), (4,3), (4,4), (4,5), (4,6), (4,7), (4,8), (4,9), (4,10), (5,1), (5,2), (5,3), (5,4), (5,5), (5,6), (5,7), (5,8), (5,9), (5,10), (6,1), (6,2), (6,3), (6,4), (6,5), (6,6), (6,7), (6,8), (6,9), (6,10), (7,1), (7,2), (7,3), (7,4), (7,5), (7,6), (7,7), (7,8), (7,9), (7,10), (8,1), (8,2), (8,3), (8,4), (8,5), (8,6), (8,7), (8,8), (8,9), (8,10), (9,1), (9,2), (9,3), (9,4), (9,5), (9,6), (9,7), (9,8), (9,9), (9,10), (10,1), (10,2), (10,3), (10,4), (10,5), (10,6), (10,7), (10,8), (10,9), (10,10). The 'C' is formed by dots at (1,1), (1,2), (1,3), (1,4), (1,5), (1,6), (1,7), (1,8), (1,9), (1,10), (2,1), (2,2), (2,3), (2,4), (2,5), (2,6), (2,7), (2,8), (2,9), (2,10), (3,1), (3,2), (3,3), (3,4), (3,5), (3,6), (3,7), (3,8), (3,9), (3,10), (4,1), (4,2), (4,3), (4,4), (4,5), (4,6), (4,7), (4,8), (4,9), (4,10), (5,1), (5,2), (5,3), (5,4), (5,5), (5,6), (5,7), (5,8), (5,9), (5,10), (6,1), (6,2), (6,3), (6,4), (6,5), (6,6), (6,7), (6,8), (6,9), (6,10), (7,1), (7,2), (7,3), (7,4), (7,5), (7,6), (7,7), (7,8), (7,9), (7,10), (8,1), (8,2), (8,3), (8,4), (8,5), (8,6), (8,7), (8,8), (8,9), (8,10), (9,1), (9,2), (9,3), (9,4), (9,5), (9,6), (9,7), (9,8), (9,9), (9,10), (10,1), (10,2), (10,3), (10,4), (10,5), (10,6), (10,7), (10,8), (10,9), (10,10). The 'I' is formed by dots at (1,1), (1,2), (1,3), (1,4), (1,5), (1,6), (1,7), (1,8), (1,9), (1,10), (2,1), (2,2), (2,3), (2,4), (2,5), (2,6), (2,7), (2,8), (2,9), (2,10), (3,1), (3,2), (3,3), (3,4), (3,5), (3,6), (3,7), (3,8), (3,9), (3,10), (4,1), (4,2), (4,3), (4,4), (4,5), (4,6), (4,7), (4,8), (4,9), (4,10), (5,1), (5,2), (5,3), (5,4), (5,5), (5,6), (5,7), (5,8), (5,9), (5,10), (6,1), (6,2), (6,3), (6,4), (6,5), (6,6), (6,7), (6,8), (6,9), (6,10), (7,1), (7,2), (7,3), (7,4), (7,5), (7,6), (7,7), (7,8), (7,9), (7,10), (8,1), (8,2), (8,3), (8,4), (8,5), (8,6), (8,7), (8,8), (8,9), (8,10), (9,1), (9,2), (9,3), (9,4), (9,5), (9,6), (9,7), (9,8), (9,9), (9,10), (10,1), (10,2), (10,3), (10,4), (10,5), (10,6), (10,7), (10,8), (10,9), (10,10). The 'E' is formed by dots at (1,1), (1,2), (1,3), (1,4), (1,5), (1,6), (1,7), (1,8), (1,9), (1,10), (2,1), (2,2), (2,3), (2,4), (2,5), (2,6), (2,7), (2,8), (2,9), (2,10), (3,1), (3,2), (3,3), (3,4), (3,5), (3,6), (3,7), (3,8), (3,9), (3,10), (4,1), (4,2), (4,3), (4,4), (4,5), (4,6), (4,7), (4,8), (4,9), (4,10), (5,1), (5,2), (5,3), (5,4), (5,5), (5,6), (5,7), (5,8), (5,9), (5,10), (6,1), (6,2), (6,3), (6,4), (6,5), (6,6), (6,7), (6,8), (6,9), (6,10), (7,1), (7,2), (7,3), (7,4), (7,5), (7,6), (7,7), (7,8), (7,9), (7,10), (8,1), (8,2), (8,3), (8,4), (8,5), (8,6), (8,7), (8,8), (8,9), (8,10), (9,1), (9,2), (9,3), (9,4), (9,5), (9,6), (9,7), (9,8), (9,9), (9,10), (10,1), (10,2), (10,3), (10,4), (10,5), (10,6), (10,7), (10,8), (10,9), (10,10).

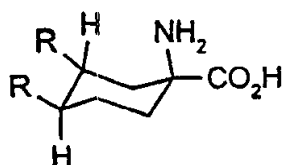
并使用氯气氧化性裂解 (B. Johnson, J. M. Sprague, J. Am. Soc. 58, 1348 (1936))

$$\text{Chemical structure (XXVI-B): A benzene ring substituted with groups V, X, Y, Z, and W, and a sulfonate group (-SO<sub>3</sub><sup>-</sup>) with a sodium counterion (Na<sup>+</sup>).$$

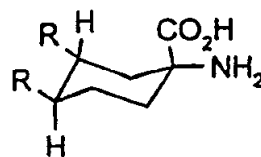
10  $V, W, X, Y$  和  $Z$  如上所述定义

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

式 (XXII) 的取代的环氨基羧酸, 其中 A 和 B 成环, 通常可通过 Bucherer-Bergs 合成方法或 Strecker 合成方法获得, 以及各自获得不同异构体。因此, 当采用 Bucherer-Bergs 合成条件时, 主要获得下述异构体 (为简便起见下文称作  $\beta$ ) 其中基团 R 和羧基处于平伏位置, 而采用 Strecker 合成条件时主要产生下述异构体 (为简便起见下文称作  $\alpha$ ), 其中氨基和基团 R 处于平伏位置。



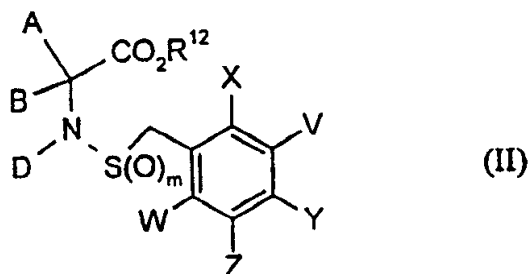
### Bucherer-Bergs 合成方法 (β异构体)



### Strecker 合成方法 ( $\alpha$ 异构体)

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

而且, 式 (II) 起始物



5

其中

A, B, D, V, W, X, Y, Z,  $R^{12}$  和  $m$  如上所述定义,

它可用于上述的方法 (A), 该起始物的制备方法是将式 (XXVII) 的氨基腈

10

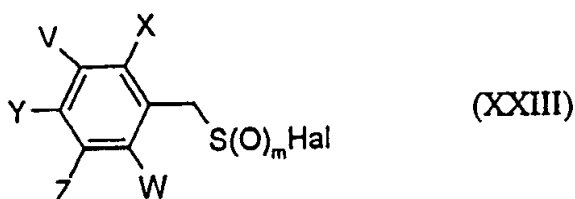


其中

A, B 和 D 如上所述定义

与式 (XXIII) 的取代的苄基-S(O)<sub>m</sub> 卤化物

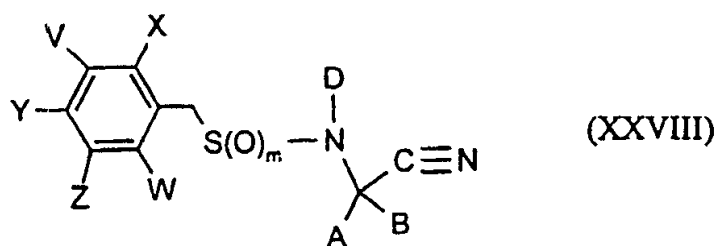
15



其中

V, W, X, Y, Z,  $m$  和 Hal 如上所述定义

转化为式 (XXVIII) 化合物

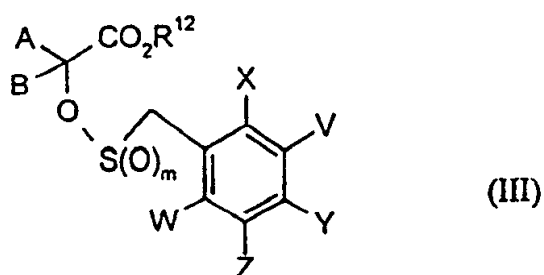


其中

A, B, D, V, W, X, Y, Z 和 m 如上所述定义,  
 然后将其进行酸性醇解。

式 (XXVIII) 化合物也是新的。

在本发明方法 (B) 中作为起始物所需的式 (III) 化合物是新的



10 其中

A, B, V, W, X, Y, Z, R<sup>12</sup> 和 m 如上所述定义。

它们可通过原则上已知的方法制备。

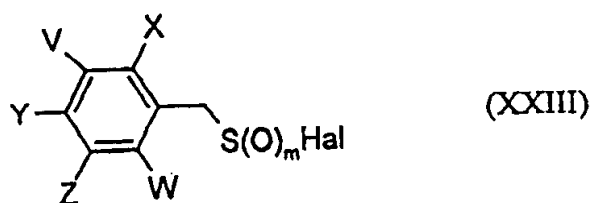
因此, 式 (III) 化合物的制备方法为, 例如  
 将式 (XXIX) 的 2-羟基羧酸酯



其中

A, B 和 R<sup>12</sup> 如上所述定义

与式 (XXIII) 的取代的苄基-S(O)<sub>m</sub> 卤化物反应

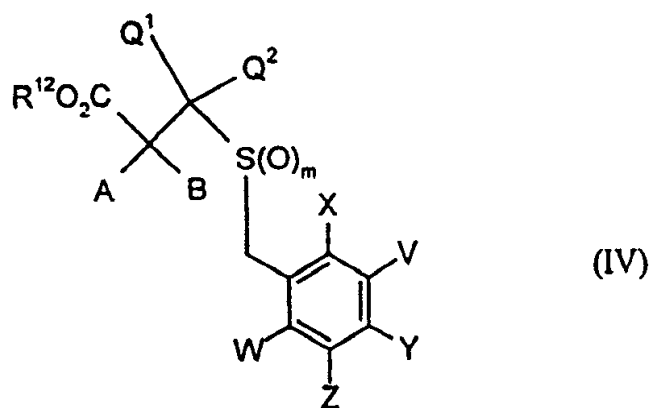


其中

V, W, X, Y, Z, m 和 Hal 如上所述定义

5 (H. -D. Stachel, G. Drasch, Arch. Pharm. 318, 304 (1985)).

式 (IV) 化合物是新的



其中

10 A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, V, W, X, Y, Z, m 和 R<sup>12</sup> 如上所述定义

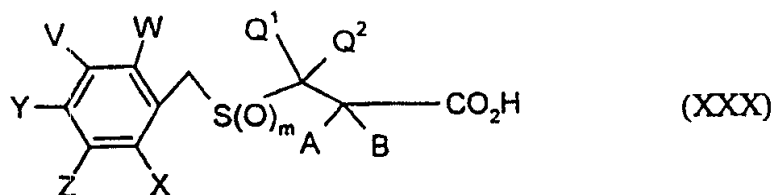
并用作上述方法 (C) 的起始物。

它们可通过原则上已知的方法制备。

式 (IV) 的 5-芳基-S(O)<sub>m</sub>-羧酸酯的制备方法, 例如为

将式 (XXX) 的 5-芳基-S(O)<sub>m</sub>-羧酸酯化

15



其中

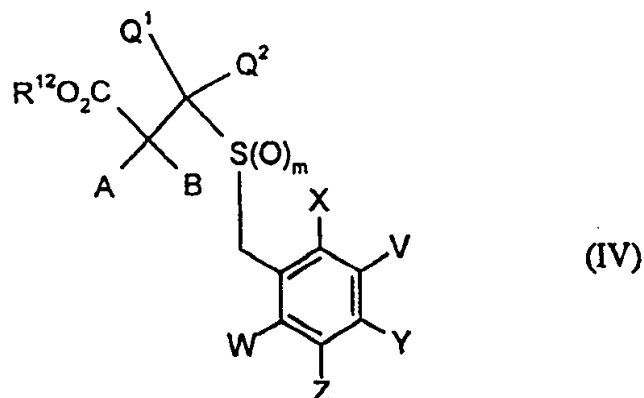
V, W, X, Y, Z, A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup> 和 m 如上所述定义

(参见 J. G. Rombardino, E. H. Wiseman, 13, 206(1970); A. Abdel-Wahab 等, Phosphorus, Sulfur and Silicon 59, 149(1991))

(还可参考制备实施例)。

而且, 式 (IV) 化合物

5



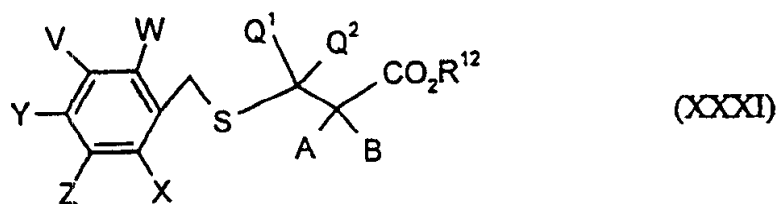
其中

A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, V, W, X, Y, Z 和 R<sup>12</sup> 如上所述定义  
和

10

m 代表 1 和 2

是通过将式 (XXXI) 的苄硫醚



其中

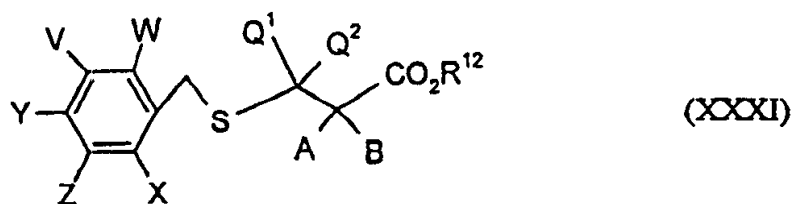
15

A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, V, W, X, Y, Z 和 R<sup>12</sup> 如上所述定义

用氧化剂如, 例如过酸, 过氧化氢, 过氧化物或氯气氧化而获得  
(参见制备实施例)。

某些式 (XXXI) 化合物是新的, 它们可通过已知方法制备获得。

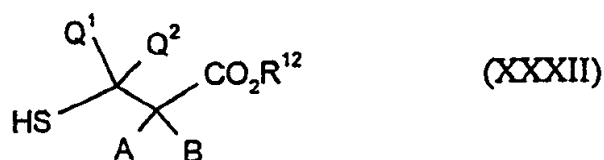
因此, 例如式 (XXXI) 化合物的制备方法为



其中

A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, V, W, X, Y, Z 和 R<sup>12</sup> 如上所述定义

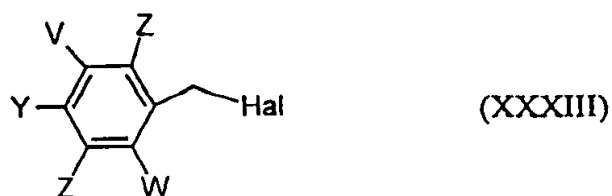
5 通过将式 (XXXII) 的巯基化合物



其中

A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup> 和 R<sup>12</sup> 如上所述定义

10 与式 (XXXIII) 的苄基卤



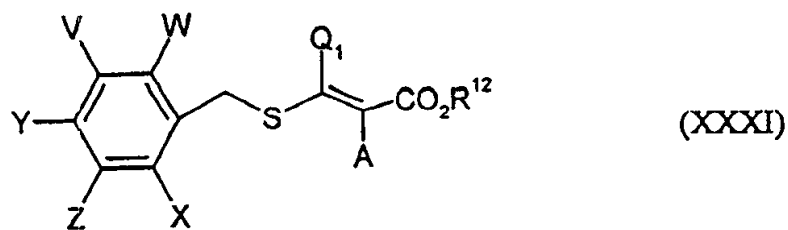
其中

V, W, X, Y 和 Z 如上所述定义以及

15 Hal 代表氯或溴

在有酸结合剂和溶剂存在条件下反应获得(参见制备实施例, 变换方法 1)。

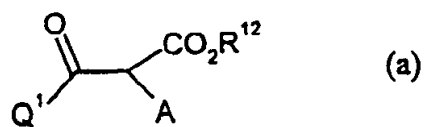
式 (XXXI) 化合物的制备方法为



其中

A, Q<sup>1</sup>, V, W, X, Y, Z 和 R<sup>12</sup> 如上所述定义  
将式 (a) 化合物

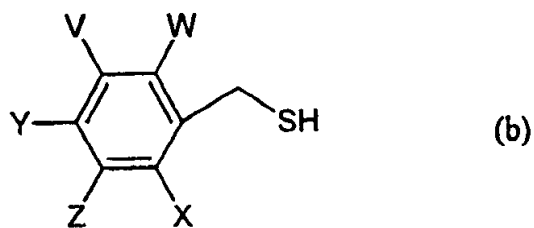
5



其中

A, Q<sup>1</sup> 和 R<sup>12</sup> 如上所述定义  
与式 (b) 化合物

10



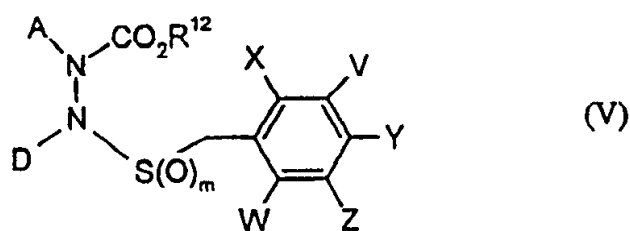
其中

V, W, X, Y 和 Z 如上所述定义

在有酸和溶剂存在条件下反应获得 (参见制备实施例, 变换方法  
2)。

15

式 (V) 化合物是新的

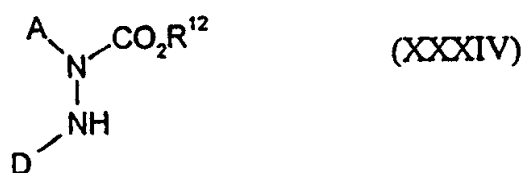


其中

A, D, V, W, X, Y, Z, m 和  $R^{12}$  如上所述定义

5 可用作本发明方法 (D) 的起始物。

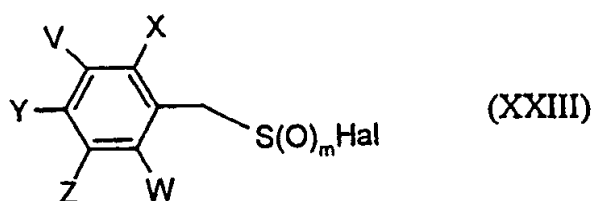
式 (V) 的氢氧化物的制备方法为, 例如将式 (XXXIV) 的氨基甲酸酯



其中

10 A 和 D 如上所述定义

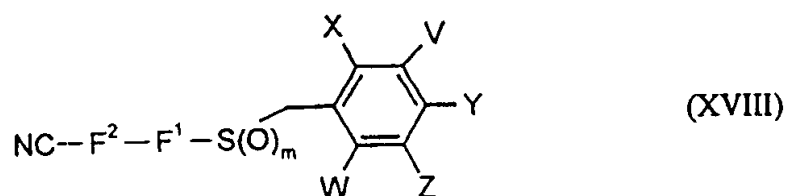
与式 (XXIII) 的取代的苄基-S(O)m 卤化物相互反应而获得



其中

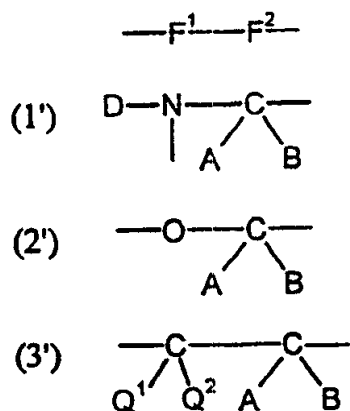
15 V, W, X, Y, Z, m 和 Hal 如上所述定义。

式 (XVIII) 化合物是新的



其中

V, W, X, Y, Z 和 m 如上所述定义以及  
F<sup>1</sup> 和 F<sup>2</sup> 代表基团



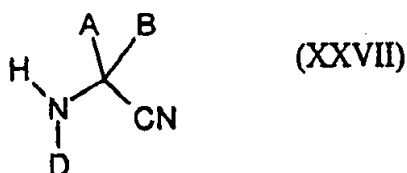
5

其中基团 A, B, D, Q<sup>1</sup> 和 Q<sup>2</sup> 如上所述定义,

如需要上述化合物可用作本发明方法 M(β) 的起始物。

式 (XVIII) 的腈化合物的制备方法, 即组 (1'), 例如将式 (XXVII)  
的氨基腈

10

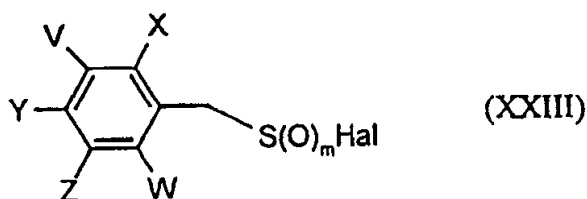


其中

A, B 和 D 如上所述定义

与式 (XXIII) 的取代的苄基-S(O)<sub>m</sub> 卤化物反应

15

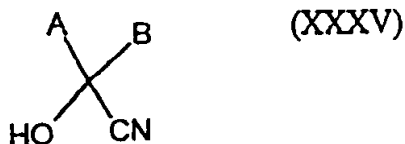


其中

V, W, X, Y, Z, m 和 Hal 如上所述定义

(S. T. Ingate, Tetrahedron 53, 17795 (1997)).

类似的, 式 (XVIII) 的腈化合物的制备方法, 即组 (2'), 例如将式 (XXXV) 的羟腈



5

其中

A 和 B 如上所述定义

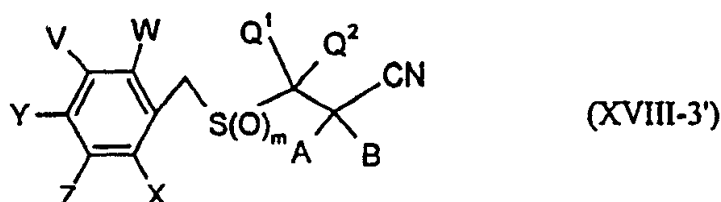
与式 (XXIII) 的取代的苄基-S(O)<sub>m</sub> 卤化物反应

其中

10 V, W, X, Y, Z, m 和 Hal 各自如上所述定义

(S. T. Ingate, Tetrahedron 53, 17795 (1997)).

另外, 式 (XVIII) 化合物, 即组 (3')



15 其中

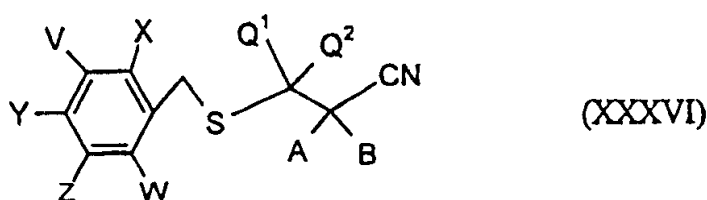
A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, V, W, X, Y 和 Z 如上所述定义

和

m 代表 1 和 2

是通过将式 (XXXVI) 的苄硫醚

20

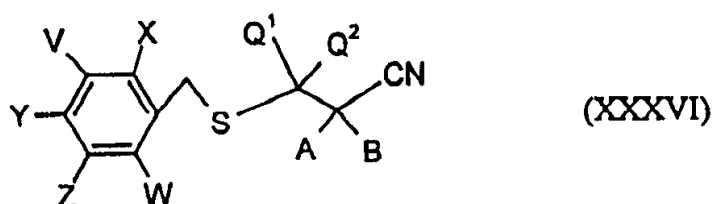


其中

A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, V, W, X, Y 和 Z 如上所述定义

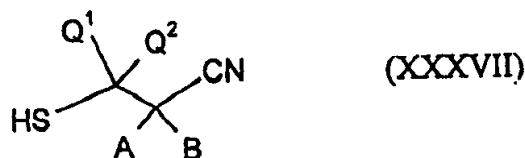
用氧化剂如, 例如过酸, 过氧化氢, 过氧化物或氯气氧化而获得  
(参见制备实施例, J. R. Beck, J. Heterocyclic Chem. 15, 513 (1978)).

- 5 某些式 (XXXVI) 化合物是新的, 它们可通过已知方法制备获得。  
因此, 例如式 (XXXVI) 化合物



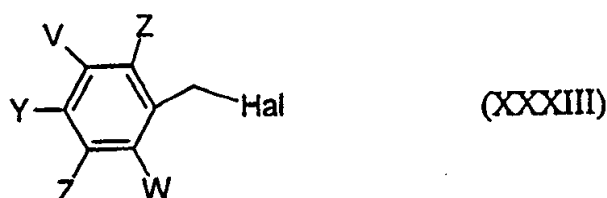
其中

- 10 A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, V, W, X, Y 和 Z 如上所述定义  
是通过下述方法获得的, 即将式 (XXXVII) 的巯基氰基化合物



其中

- 15 A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup> 和 R<sup>12</sup> 如上所述定义  
与式 (XXXIII) 的苄基卤



其中

- 20 V, W, X, Y 和 Z 如上所述定义以及  
Hal 代表氯或溴  
在有酸结合剂和溶剂存在条件下反应, 或根据

J. R. Beck, J. Heterocyclic Chem. 15, 513 (1978) 描述的方法, 或根据制备实施例方法制备。

其它用作本发明方法 (E), (F), (G), (H), (I), (J), (K), (L), (M), (N) 和 (O) 的起始化合物的式 (VI) 和 (XIX) 的酰基卤, 式 (VII) 和 (XX) 的羧酸酐, 式 (VIII) 的氯甲酸酯或硫代氯甲酸酯, 式 (IX) 的一硫代氯甲酸酯或二硫代氯甲酸酯, 式 (X) 的磺酰氯, 式 (XI) 的磷化合物和式 (XII) 和 (XIII) 的金属氢氧化物, 金属醇盐或胺以及式 (XIV) 的异氰酸酯和式 (XV) 的氨基甲酰氯, 式 (XVI) 的烷基化剂和通式 (XVII) 的胺一般是有机或无机化学领域中的已知化合物。

10 方法 (A) 的特征在于将式 (II) 化合物, 其中 A, B, D, V, W, X, Y, Z, m 和  $R^{12}$  如上所述定义, 在有碱存在的条件下进行分子内缩合。

适用于本发明方法 (A) 的稀释剂可以是所有惰性有机溶剂。优选使用烃, 如甲苯和二甲苯, 还有醚类如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲醚或二乙二醇二甲醚, 还包括极性溶剂, 如二甲基亚砷、环丁砷、二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺和 N-甲基吡咯烷酮, 以及醇类如  
15 甲醇、乙醇、正丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

适用于本发明方法 (A) 的碱 (脱质子化剂) 是所有常规质子接受体。优选使用碱金属和碱土金属氧化物, 氢氧化物和碳酸盐, 如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙, 还可以  
20 使用相转移催化剂, 如例如氯化三乙基苄基铵、溴化四丁基铵、Adogen 464 (=氯化甲基三烷基 ( $C_8-C_{10}$ ) 铵) 或 TDA 1 (=三-(甲氧基乙氧基乙基)-胺)。还可以使用碱金属, 如钠或钾。而且, 可以使用氨基碱金属和碱土金属以及碱金属和碱土金属氢化物, 如氨基化钠, 氢化钠和氢化钙, 以及还可以使用碱金属醇盐, 如甲醇钠, 乙醇钠和叔丁醇钾。另  
25 外还可以使用, 例如叔胺, 如三乙胺, 吡啶, 二氮杂二环辛烷 (DABCO), 二氮杂二环十一碳烯 (DBU), 二氮杂二环壬烯 (DBN) 和 Hünig 碱。

在本发明制备方法 (A) 中, 反应温度可在较宽的范围内变化。一般, 该方法在  $0^{\circ}\text{C}$  至  $250^{\circ}\text{C}$ , 优选  $20^{\circ}\text{C}$  至  $150^{\circ}\text{C}$  下进行。

通常本发明方法 (A) 在大气压下进行。

30 当采用本发明制备方法 (A) 时, 通常使用式 (II) 反应组分和使用脱质子化碱等摩尔量的约两倍。然而, 还可以较大过量 (至多 3 摩尔) 地使用一种或另一种组分。

方法(B)的特征在于将式(III)化合物, 其中 A, B, V, W, X, Y, Z, m 和  $R^{12}$  如上所述定义, 在有稀释剂和碱存在的条件下进行分子内缩合。

适用于本发明方法(B)的稀释剂可以是所有惰性有机溶剂。优选使用炔, 如甲苯和二甲苯, 还有醚类如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲醚和二乙二醇二甲醚, 还包括极性溶剂, 如二甲基亚砷、环丁砷、二甲基甲酰胺和 N-甲基吡咯烷酮。还可以使用醇类如甲醇、乙醇、正丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

适用于本发明方法(B)的碱(脱质子化剂)是所有常规质子接受体。优选使用碱金属和碱土金属氧化物, 氢氧化物和碳酸盐, 如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙, 还可以使用相转移催化剂, 如例如氯化三乙基苄基铵、溴化四丁基铵、Adogen 464(=氯化甲基三烷基( $C_8-C_{10}$ )铵)或 TDA 1(=三-(甲氧基乙氧基乙基)-胺)。还可以使用碱金属, 如钠或钾。而且, 可以使用氨基碱金属和碱土金属以及碱金属和碱土金属氢化物, 如氨基化钠, 氢化钠和氢化钙, 以及还可以使用碱金属醇盐, 如甲醇钠, 乙醇钠和叔丁醇钾。另外还可以使用, 例如叔胺, 如三乙胺, 吡啶, DABCO, DBU, DBN 和 Hünig 碱。

在本发明制备方法(B)中, 反应温度可在较宽的范围内变化。一般, 该方法在  $0^{\circ}\text{C}$  至  $250^{\circ}\text{C}$ , 优选  $20^{\circ}\text{C}$  至  $150^{\circ}\text{C}$  下进行。

通常本发明方法(B)在大气压下进行。

当采用本发明制备方法(B)时, 通常式(III)反应组分和脱质子化碱使用近似等摩尔量。然而, 还可以较大过量(至多 3 摩尔)地使用一种或另一种组分。

方法(C)的特征在于将式(IV)化合物, 其中 A, B,  $Q^1$ ,  $Q^2$ , V, W, X, Y, Z, m 和  $R^{12}$  如上所述定义, 在有碱存在的条件下进行分子内缩合。

适用于本发明方法(C)的稀释剂可以是对反应物具有惰性的所有有机溶剂。优选使用炔, 如甲苯和二甲苯, 还有醚类如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲醚或二乙二醇二甲醚, 还包括极性溶剂, 如二甲基亚砷、环丁砷、二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺和 N-甲基吡咯烷酮。还可以使用醇类如甲醇、乙醇、正丙醇、异丙醇、丁醇、异丁

醇和叔丁醇。

适用于本发明方法(C)的碱(脱质子化剂)是所有常规质子接受体。优选使用碱金属和碱土金属氧化物,氢氧化物和碳酸盐,如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙,还可以使用相转移催化剂,如例如氯化三乙基苄基铵、溴化四丁基铵、Adogen 464(=氯化甲基三烷基(C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>)铵)或 TDA 1(=三-(甲氧基乙氧基乙基)-胺)。还可以使用碱金属,如钠或钾。而且,可以使用氨基碱金属和碱土金属以及碱金属和碱土金属氢化物,如氨基化钠,氢化钠和氢化钙,以及还可以使用碱金属醇盐,如甲醇钠,乙醇钠和叔丁醇钾。另外还可以使用叔胺,如三乙胺,吡啶, DABCO, DBU, DBN 和 Hünig 碱。

在本发明制备方法(C)中,反应温度可在较宽的范围内变化。一般,该方法在-75℃至250℃,优选0℃至150℃下进行。

通常本发明方法(C)在大气压下进行。

当采用本发明制备方法(C)时,通常式(IV)反应组分和脱质子化碱使用近似等摩尔量。然而,还可以较大过量(至多3摩尔)地使用一种或另一种组分。

方法(D)的特征在于将式(V)化合物,其中A,D,V,W,X,Y,Z,m和R<sup>12</sup>如上所述定义,在有碱存在的条件下进行分子内缩合。

适用于本发明方法(D)的稀释剂可以是对反应物具有惰性的所有有机溶剂。优选使用烃,如甲苯和二甲苯,还有醚类如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲醚或二乙二醇二甲醚,还包括极性溶剂,如二甲基亚砷、环丁砷、二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺和N-甲基吡咯烷酮。还可以使用醇类,如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

适用于本发明方法(D)的碱(脱质子化剂)是所有常规质子接受体。

优选使用碱金属和碱土金属氧化物,氢氧化物和碳酸盐,如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙,还可以使用相转移催化剂,如例如氯化三乙基苄基铵、溴化四丁基铵、Adogen 464(氯化甲基三烷基(C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>)铵)或 TDA 1(三-(甲氧基乙氧基乙基)-胺)。还可以使用碱金属,如钠或钾。而且,可以使用氨基碱金属和碱土金属以及碱金属和碱土金属氢化物,如氨基化钠,氢化钠和

氯化钙, 以及还可以使用碱金属醇盐, 如甲醇钠, 乙醇钠和叔丁醇钾。另外还可以使用, 例如叔胺, 如三乙胺, 吡啶, DABCO, DBU, DBN 和 Hünig 碱。

在本发明制备方法 (D) 中, 反应温度可在较宽的范围内变化。一般, 该方法在 0℃ 至 250℃, 优选 50℃ 至 150℃ 下进行。

通常本发明方法 (D) 在大气压下进行。

当采用本发明制备方法 (D) 时, 通常式 (V) 反应组分和脱质子化碱使用近似等摩尔量。然而, 还可以较大过量 (至多 3 摩尔) 地使用一种或另一种组分。

方法 (E- $\alpha$ ) 的特征在于如需要在有稀释剂以及如需要存在酸结合剂的条件下将式 (I-1-a) 至 (I-4-a) 化合物各自与式 (VI) 的酰卤反应。

适用于本发明方法 (E- $\alpha$ ) 的稀释剂可以是对酰基卤具有惰性的所有溶剂。优选使用烃, 如汽油, 苯, 甲苯, 二甲苯和四氢化萘, 以及卤代烃, 如二氯甲烷, 氯仿, 四氯化碳, 氯苯和邻二氯苯, 而且还包括酮类, 如丙酮和甲基异丙基酮, 还有醚类如乙醚、四氢呋喃和二噁烷, 还包括羧酸酯如乙酸乙酯, 以及强极性溶剂如二甲基亚砷和环丁砷。如果酰基卤的水解稳定性允许, 反应还可以在有水的条件下进行。

适用于本发明方法 (E- $\alpha$ ) 的酸结合剂是所有常规酸性接受体。优选使用叔胺, 如三乙胺, 吡啶, N, N-二甲基氨基吡啶 (DMAP), 二氮杂二环辛烷 (DABCO), 二氮杂二环十一碳烯 (DBU), 二氮杂二环壬烯 (DBN), Hünig 碱和 N, N-二甲基苯胺, 而且还包括碱土金属氧化物, 如氧化镁和氧化钙, 另外可以使用碱金属和碱土金属碳酸盐, 如碳酸钠, 碳酸钾和碳酸钙, 以及碱金属氢氧化物, 如氢氧化钠和氢氧化钾。

在本发明制备方法 (E- $\alpha$ ) 中, 反应温度可在较宽的范围内变化。一般, 该方法在 -20℃ 至 +150℃, 优选 0℃ 至 100℃ 下进行。

当采用本发明制备方法 (E- $\alpha$ ) 时, 通常起始物式 (I-1-a) 至 (I-4-a) 化合物和式 (VI) 的酰卤各自使用近似等摩尔量。然而, 还可使用较大过量 (至多 5 摩尔) 的酰卤。处理是以常规方法进行。

方法 (E- $\beta$ ) 的特征在于如需要在有稀释剂以及如需要存在酸结合剂的条件下将式 (I-1-a) 至 (I-4-a) 化合物与式 (VII) 的羧酸酐反应。

适用于方法(E- $\beta$ )的稀释剂优选当使用酰基卤时所优选的那些稀释剂。另外,还可以使用过量的羧酸酐同时作为稀释剂。

如需要在方法(E- $\beta$ )中加入的酸结合剂优选当使用酰基卤时所优选的那些酸结合剂。

- 5 在本发明制备方法(E- $\beta$ )中,反应温度可在较宽的范围内变化。一般,该方法在 $-20^{\circ}\text{C}$ 至 $+150^{\circ}\text{C}$ ,优选 $0^{\circ}\text{C}$ 至 $100^{\circ}\text{C}$ 下进行。

当采用本发明制备方法(E- $\beta$ )时,通常起始物式(I-1-a)至(I-4-a)化合物和式(VII)的羧酸酐各自使用近似等摩尔量。然而,还可使用较大过量(至多5摩尔)的羧酸酐。处理是以常规方法进行。

- 10 通常,稀释剂和过量的羧酸酐和形成的羧酸通过蒸馏或用有机溶剂或用水洗涤而除去。

方法(F)的特征在于如需要在有稀释剂以及如需要存在酸结合剂的条件将式(I-1-a)至(I-4-a)化合物各自与式(VIII)的氯甲酸酯或硫代氯甲酸酯反应。

- 15 适用于本发明方法(F)的酸结合剂是所有常规酸性接受体。优选使用叔胺,如三乙胺,吡啶,DABCO,DBU,DBA,Hünig碱和N,N-二甲基苯胺,而且还包括碱土金属氧化物,如氧化镁和氧化钙,另外可以使用碱金属和碱土金属碳酸盐,如碳酸钠,碳酸钾和碳酸钙,以及碱金属氢氧化物,如氢氧化钠和氢氧化钾。

- 20 适用于本发明方法(F)的稀释剂可以是对氯甲酸酯或硫代氯甲酸酯具有惰性的所有溶剂。优选使用烃,如汽油,苯,甲苯,二甲苯和四氯化苯,以及卤代烃,如二氯甲烷,氯仿,四氯化碳,氯苯和邻二氯苯,而且还包括酮类,如丙酮和甲基异丙基酮,还有醚类如乙醚、四氢呋喃和二噁烷,还包括羧酸酯如乙酸乙酯,以及强极性溶剂如二甲基亚砷和  
25 环丁砜。

在本发明制备方法(F)中,反应温度可在较宽的范围内变化。如果反应在有稀释剂和酸结合剂的条件下进行,一般反应温度在 $-20^{\circ}\text{C}$ 至 $+100^{\circ}\text{C}$ ,优选 $0^{\circ}\text{C}$ 至 $50^{\circ}\text{C}$ 下进行。

通常本发明方法(F)是在大气压下进行。

- 30 当采用本发明制备方法(F)时,通常起始物式(I-1-a)至(I-4-a)化合物和适合的式(VIII)的氯甲酸酯或硫代氯甲酸酯各自使用近似等摩尔量。然而,还可使用较大过量(至多2摩尔)的一种或另一种组

分。处理是以常规方法进行。一般，将沉淀出来的盐除去并通过反萃取掉 (Abziehen) 稀释剂而将剩余反应混合物浓缩。

本发明方法 (G) 的特征在于将式 (I-1-a) 至 (I-4-a) 化合物各自与式 (IX) 化合物在有稀释剂以及如需要存在酸结合剂的条件反应。

5 在制备方法 (G) 中，在 0-120℃，优选 20-60℃ 下，每摩尔式 (I-1-a) 至 (I-4-a) 起始物使用约 1 摩尔的式 (IX) 的一硫代氯甲酸酯或二硫代氯甲酸酯。

如需要可加入的适合的稀释剂是所有惰性极性有机溶剂如醚，酯，酰胺，砜，亚砜，以及卤代烷。

10 优选使用二甲基亚砜，乙酸乙酯，四氢呋喃，二甲基甲酰胺或二氯甲烷。

在优选实施方案中，通过加入强脱质子化剂如，例如氢化钠或叔丁醇钾，制备化合物 (I-1-a) 至 (I-4-a) 的烯醇化盐，无需加入酸结合剂。

15 如果使用酸结合剂，则它们可以是常规无机或有机碱，可提及的实例包括氢氧化钠，碳酸钠，碳酸钾，吡啶和三乙胺。

反应在大气压或升压条件下进行，优选在大气压下进行。以常规方法进行处理。

20 本发明方法 (H) 的特征在于如需要有稀释剂以及如需要存在酸结合剂的条件将式 (I-1-a) 至 (I-4-a) 化合物各自与式 (X) 的磺酰氯反应。

在制备方法 (H) 中，在 -20-150℃，优选 20-70℃ 下，每摩尔式 (I-1-a) 至 (I-8-a) 起始物使用约 1 摩尔的式 (X) 的磺酰氯。

25 如需要可加入的适合的稀释剂是所有惰性极性有机溶剂，如醚，酰胺，腈，砜，亚砜，或卤代烃，如二氯甲烷。

优选使用二甲基亚砜，四氢呋喃，二甲基甲酰胺，二氯甲烷。

在优选实施方案中，通过加入强脱质子化剂 (如，例如氢化钠或叔丁醇钾) 制备化合物 (I-1-a) 至 (I-4-a) 的烯醇化盐，而无需再加入酸结合剂。

30 如果使用酸结合剂，它们可以是常规无机或有机碱，可提及的实例包括氢氧化钠，碳酸钠，碳酸钾，吡啶和三乙胺。

反应在大气压或升压条件下进行并优选在大气压下进行。以常规

方法进行处理。

本发明方法(I)的特征在于如需要有稀释剂以及如需要存在酸结合剂的条件下将式(I-1-a)至(I-4-a)化合物各自与式(XI)的磷化合物反应。

- 5 在制备方法(I)中,为获得式(I-1-e)至(I-4-e)化合物,在-40-150℃,优选-10-110℃下,每摩尔化合物(I-1-a)至(I-4-a)使用 1-2,优选 1-1.3 摩尔的式(XI)的磷化合物。

如需要可加入的适合的稀释剂是所有惰性极性有机溶剂,如醚,酯,酰胺,腈,醇,硫醚,砜,亚砜等。

- 10 优选使用乙腈,二甲基亚砜,乙酸乙酯,四氢呋喃,二甲基甲酰胺,二氯甲烷。

如需要可加入的酸结合剂,可以是常规无机或有机碱,如氢氧化物,碳酸盐或胺。可提及的实例包括氢氧化钠,碳酸钠,碳酸钾,吡啶和三乙胺。

- 15 反应在大气压或升压条件下进行并优选在大气压下进行。有机化学的常规方法进行处理。优选通过结晶,色谱纯化或所谓的“初期蒸馏(Andestillieren)”,即减压条件下除去挥发性组分的方法对获得的最终产物进行纯化。

- 20 方法(J)的特征在于如需要存在稀释剂的条件下将式(I-1-a)至(I-4-a)化合物与式(XII)的金属氢氧化物或金属醇盐或式(XIII)的胺反应。

本发明方法(J)中优选使用的稀释剂是醚,如四氢呋喃,二噁烷,乙醚,或醇,如甲醇,乙醇,异丙醇以及水。

本发明方法(J)通常在大气压下进行。

- 25 通常反应温度在-20℃-100℃,优选 0℃-50℃ 范围内。

本发明方法(K)的特征在于如需要有稀释剂和如需要存在催化剂的条件下将式(I-1-a)至(I-4-a)化合物各自与式(XIV)的(K-α)化合物反应或如需要有稀释剂以及如需要存在酸结合剂的条件下与式(XV)的(K-β)化合物反应。

- 30 在制备方法(K-α)中,在 0-100℃,优选 20-50℃下,每摩尔式(I-1-a)至(I-4-a)起始化合物使用约 1 摩尔的式(XIV)的异氰酸酯。

如需要加入的适合的稀释剂是所有惰性有机溶剂,如醚,酰胺,腈,

砷, 亚砷。

如需要, 为加速反应可加入催化剂。特别优选的催化剂是有机锡化合物, 如, 例如二月桂酸二丁锡。该方法优选在大气压下进行。

在制备方法(K-β)中, 在-20-150℃, 优选 0-70℃下, 每摩尔式(I-1-a)至(I-4-a)起始化合物使用约 1 摩尔的式(XV)的氨基甲酰氯或硫代氨基甲酰氯。

如需要加入的适合的稀释剂是所有惰性极性有机溶剂, 如醚, 酯, 酰胺, 砷, 亚砷或卤代烃。

10 优选使用二甲基亚砷, 四氢呋喃, 乙酸乙酯, 二甲基甲酰胺或二氯甲烷。

在优选实施方案中, 通过加入强脱质子化剂(如, 例如氢化钠或叔丁醇钾)制备化合物(I-1-a)至(I-4-a)的烯醇化盐, 而无需再加入酸结合剂。

15 如果使用酸结合剂, 则它们可以是常规无机或有机碱, 可提及的实例包括氢氧化钠, 碳酸钠, 碳酸钾, 三乙胺或吡啶。

反应在大气压或升压条件下进行并优选在大气压下进行。以常规方法进行处理。

20 本发明方法(L)的特征在于如需要有稀释剂以及如需要存在酸结合剂的条件将式(I-1-a)至(I-4-a)化合物各自与式(XVI)的烷基化剂反应。

25 制备本发明化合物的本发明制备方法(L)中使用的适合的稀释剂是惰性有机溶剂。优选使用脂族、脂环族或芳族的, 并可任意选择卤代的烃, 如汽油、苯、甲苯、二甲苯、戊烷、己烷、庚烷、环己烷、石油醚、粗汽油(Ligroin)、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、氯苯或二氯苯; 醚类如乙醚、二异丙基醚、二噁烷、四氢呋喃或乙二醇二乙醚或乙二醇二甲醚; 酮类如丙酮、丁酮、甲基异丙酮或甲基异丁酮; 酯如乙酸乙酯; 酸如乙酸; 腈如乙腈或丙腈; 酰胺如二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲基磷酰三胺。如果使用液体形式的式(XVI)化合物作为反应物, 还可以使用适当过量的该化合物同时  
30 作为稀释剂。

适合的酸结合剂是所有常用的无机和有机碱。优选使用碱金属氢化物, 氢氧化物, 氮化物, 碳酸盐或碳酸氢盐, 如氢化钠、氨基化钠、氢

氧化钠、碳酸钾或碳酸氢钠,以及还可以使用叔胺,如三乙胺,N,N-二甲基苯胺,吡啶,4-(N,N-二甲基氨基)-吡啶,二氮杂二环辛烷(DABCO),二氮杂二环壬烯(DBU)或Hünig碱。

该方法中,反应温度可在较宽的范围内变化。一般,该方法在-20  
5 °C至+200°C,优选0°C至150°C下进行。

用于制备本发明化合物的本发明方法(L)中,通常每摩尔式(I-1-a)至(I-4-a)化合物各自使用1-20摩尔,优选各自1-5摩尔的式(XVI)烷基化剂以及如需要加入1-5摩尔,优选1-2摩尔的酸结合剂。反应以及处理操作和反应产物的分离是通过常规方法进行的(还可参考制  
10 备实施例)。

方法(M- $\alpha$ )的特征在于如需要有稀释剂以及如需要存在酸催化剂和脱水剂的条件下将式(I-1-a)至(I-4-a)化合物各自与式(XVII)的胺反应。

本发明方法(M- $\alpha$ )中优选使用的稀释剂是惰性有机溶剂。它们特  
15 别包括脂族、脂环族或芳族的,并可任意选择卤代的烃,如汽油、粗汽油、苯、甲苯、二甲苯、氯苯、石油醚、戊烷、己烷、庚烷、环己烷、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳;醚类如乙醚、二噁烷、四氢呋喃或乙二醇二甲醚或乙二醇二乙醚;腈如乙腈或丙腈;酰胺如二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺、N-甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲基磷酰三胺;  
20 或酯类如乙酸乙酯。液体形式以及适当过量的式(XVII)的胺,还可以作为溶剂使用。

本发明方法(M- $\alpha$ )中,反应温度可在较宽的范围内变化。一般,该方法在0°C至250°C,优选20°C至200°C下进行。

通常本发明方法(M- $\alpha$ )是在升压下进行。为实施本发明方法(M-  
25  $\alpha$ ),可在较大范围内变化。通常反应温度为0°C至250°C,优选0°C至250°C,优选0°C至200°C。

本发明方法(M- $\alpha$ )可在升压下进行。本发明方法(M- $\alpha$ ),通常每摩尔式(I-1-a)至(I-4-a)化合物使用1-20摩尔,优选1-5摩尔的式(XVII)的胺以及如需要加入1-5摩尔的脱水剂。反应以及处理操作和  
30 反应产物的分离是采用类似于常用的已知方法进行的。

适用于方法(M- $\alpha$ )的酸是有机酸,例如乙酸,三氟乙酸或对甲苯磺

酸。

适用于方法(M- $\alpha$ )的脱水剂是常用的干燥剂,如,例如硫酸钠,硫酸镁或氯化钙,以及分子筛。另外,形成的反应水可通过蒸馏作为共沸混合物除去。

5 用于制备式(I-1-i)至(I-4-i)化合物的本发明方法(M- $\beta$ )的特征在于将式(XVIII)化合物在有碱存在的条件下进行分子内缩合。

适用于制备式(I-1-i)至(I-4-i)化合物的本发明方法的稀释剂是所有常规惰性有机溶剂。优选使用烃,如甲苯和二甲苯,还有醚,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,另外还包括极性溶剂,如二甲基亚砷,环丁砷,二甲基甲酰胺,二甲基乙酰胺和 N-甲基-吡咯烷酮。

适用于制备式(I-1-i)至(I-4-i)化合物的本发明方法(M- $\beta$ )的脱质子化剂是所有常规质子接受体。优选使用碱金属和碱土金属氧化物,氢氧化物和碳酸盐,如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙,还可以在有相转移催化剂的条件下进行反应,相转移催化剂例如是氯化三乙基苄基铵、氯化四丁基铵或硫酸氢四丁基铵、Adogen 464<sup>1</sup>或 TDA 1<sup>2</sup>。还可以使用氨基化碱金属和碱土金属以及碱金属和碱土金属氢化物,如氨基化钠,氢化钠和氢化钙,以及还可以使用碱金属醇盐,如甲醇钠,乙醇钠和叔丁醇钾。

20 在制备式(I-1-i)至(I-4-i)化合物的本发明制备方法(M- $\beta$ )中,反应温度可在较宽的范围内变化。一般,该方法在-20℃至250℃,优选0℃至150℃下进行。

通常本发明方法在大气压下进行。

25 当采用制备式(I-1-i)至(I-4-i)化合物的本发明制备方法(M- $\beta$ )时,通常式(XVIII)反应组分和脱质子化碱使用近似等摩尔量。然而,还可以较大过量(至多5摩尔)地使用一种或另一种组分。

方法(N- $\alpha$ )的特征在于将式(I-1-i<sup>1</sup>)至(I-4-i<sup>1</sup>)化合物与式(XIX)的酰基卤反应。当使用酰基卤时适用于本发明方法(N- $\alpha$ )的稀释剂是所有对上述化合物具有惰性的溶剂。优选使用烃,如汽油,苯,甲苯,

<sup>1</sup>Adogen 464 = 氯化甲基三烷基(C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>)铵

<sup>2</sup>TDA 1 = 三-(甲氧基乙氧基乙基)-胺

二甲苯和四氢化萘,另外还可以使用卤代烃,如二氯甲烷,氯仿,四氯化碳,氯苯和邻二氯苯,而且可以使用酮,如丙酮和甲基异丙基酮,以及醚,如乙醚,四氢呋喃和二噁烷,腈,如乙腈,此外还使用溶剂,如二甲基亚砷和环丁砷。

- 5        如果在本发明方法(N- $\alpha$ )中使用酸结合剂,则它们可以是所有常规酸性接受体。优选使用叔胺,如三乙胺,吡啶,4-N,N-二甲基氨基吡啶(DMAP),二氮杂二环辛烷(DABCO),二氮杂二环十一碳烯(DBU),二氮杂二环壬烯(DBN),Hünig碱和N,N-二甲基苯胺,而且还包括碱土金属氧化物,如氧化镁和氧化钙,另外可以使用碱金属和碱土金属碳酸盐,如碳酸钠,碳酸钾和碳酸钙,以及金属氢化物,如氢化钠。

在本发明制备方法(N- $\alpha$ )中,即使当使用酰基卤时,反应温度也可在较宽的范围内变化。一般,该方法在-20℃至+250℃,优选0℃至150℃下进行。

- 15        当采用本发明制备方法(N- $\alpha$ )时,通常起始物式(I-1-i<sup>1</sup>)至(I-4-i<sup>1</sup>)化合物和式(XIX)的酰基卤使用近似等摩尔量。然而,还可使用较大过量(至多5摩尔)的酰基卤。处理是以常规方法进行。

方法(N- $\beta$ )的特征在于将式(I-1-i<sup>1</sup>)至(I-4-i<sup>1</sup>)化合物与式(XX)的羧酸酐反应。

- 20        本发明方法(N- $\beta$ )中,如果使用羧酸酐作为式(XX)的反应物,则稀释剂优选使用当应用酰基卤时优选使用的那些稀释剂。另外,也可以过量使用羧酸酐以同时用作稀释剂。优选的酸结合剂也是当应用酰基卤时优选使用的那些碱。

- 25        在本发明制备方法(N- $\beta$ )中,即使当使用羧酸酐时,反应温度也可在较宽的范围内变化。一般,该方法在-20℃至+250℃,优选0℃至150℃下进行。

当采用本发明制备方法时,通常起始物式(I-1-i<sup>1</sup>)至(I-4-i<sup>1</sup>)化合物和式(XX)的羧酸酐使用近似等摩尔量。然而,还可使用较大过量(至多5摩尔)的羧酸酐。处理是以常规方法进行。

- 30        一般,稀释剂和过量的羧酸酐以及形成的羧酸通过蒸馏或通过有机溶剂或水洗涤而去除。

另外,在方法(N)中,还可以使用式(XIX)的酰基氯和式(XX)的羧酸酐的混合物。

方法(N-γ)的特征在于在惰性溶剂中将式(I-1-a<sup>1</sup>)至(I-4-a<sup>1</sup>)化合物各自与式(XXI)的原甲酸酯反应。优选使用烃,如汽油,苯,甲苯,二甲苯和四氢化萘,还可以使用卤代烃,如二氯甲烷,氯仿,四氯化碳,氯苯和邻二氯苯,还有醚,如乙醚,四氢呋喃和二噁烷,以及强极性溶  
5 剂,如二甲基亚砷和环丁砷。

在本发明制备方法(N-γ)中,反应温度也可在较宽的范围内变化。一般,该方法在-20℃至+250℃,优选0℃至150℃下进行。

当采用本发明制备方法(N-γ)时,通常起始物式(I-1-i<sup>1</sup>)至(I-4-i<sup>1</sup>)化合物和式(XXI)的原甲酸酯各使用近似等摩尔量。然而,还可使  
10 用较大过量(至多5摩尔)的原甲酸酯或甚至可作为溶剂使用。处理是以常规方法进行。

方法(0)的特征在于,如需要有稀释剂以及如需要存在酸结合剂  
的条件下将式(I-1-i<sup>2</sup>)至(I-4-i<sup>2</sup>)化合物各自与式(XIX)的酰基卤反  
应。

适用于本发明方法(0)的稀释剂可以是对酰基卤具有惰性的所有  
15 溶剂。优选使用烃,如汽油,苯,甲苯,二甲苯和四氢化萘,以及卤代烃,如二氯甲烷,氯仿,四氯化碳,氯苯和邻二氯苯,而且还包括酮类,如丙酮和甲基异丙基酮,还有醚类,如乙醚、四氢呋喃和二噁烷,还包括羧酸酯,如乙酸乙酯,以及强极性溶剂,如二甲基亚砷和环丁砷。如果  
20 酰基卤的水解稳定性允许,反应还可以在有水的条件下进行。

适用于本发明方法(0)的酸结合剂是所有常规酸性接受体。优选  
使用叔胺,如三乙胺,吡啶,N,N-二甲基氨基吡啶(DMAP),二氮杂二环  
辛烷(DABCO),二氮杂二环十一碳烯(DBU),二氮杂二环壬烯  
(DBN),Hünig碱和N,N-二甲基苯胺,而且还包括碱土金属氧化物,如  
25 氧化镁和氧化钙,另外可以使用碱金属和碱土金属碳酸盐,如碳酸钠,碳酸钾和碳酸钙,以及碱金属氢氧化物,如氢氧化钠和氢氧化钾,以及金属氢化物,如氢化钠。

在本发明制备方法(0)中,反应温度可在较宽的范围内变化。一般,  
该方法在-20℃至+150℃,优选0℃至100℃下进行。

当采用本发明制备方法(0)时,通常起始物式(I-1-i<sup>2</sup>)至(I-4-i<sup>2</sup>)  
30 化合物和式(XIX)的酰基各自使用近似等摩尔量。然而,还可使用较大过量(至多5摩尔)的酰基。处理是以常规方法进行。

本发明活性化合物适合防治有害动物,特别是在农业、林业、储藏产品和材料的保护,以及卫生领域中发生的昆虫和螨类和线虫,同时具有很好的植物耐受性以及对温血动物的可以接受的毒性。它们可优选用作作物保护剂。它们对正常敏感和抗性种类以及对所有或一些发育阶段都具有活性。上述有害动物包括:

等足目: 例如, 潮虫 (*Oniscus asellus*)、平甲虫和鼠妇。

倍足目: 例如, 具斑马陆。

唇足目: 例如, 食果地蜈蚣和蚰蜒属。

综合目: 例如, 庭园么蚰。

10 缨尾目: 例如, 台湾衣鱼。

弹尾目: 例如, 武装棘跳虫。

直翅目: 例如, 家蟋蟀、蝼蛄属、非洲飞蝗、黑蝗属和沙漠蝗。

蜚蠊目: 例如, 东方蜚蠊、美洲大蠊、马得拉蜚蠊、德国小蠊。

革翅目: 例如, 欧洲球螋。

15 等翅目: 例如, 散白蚁属。

虱目: 例如, 体虱、血虱属、顎虱属、嚼虱属和畜虱属。

缨翅目: 例如, 温室条蓟马、烟蓟马、棕榈蓟马和苜蓿蓟马。

异翅亚目: 例如, 扁盾蝽属、棉红蝽 (*Dysdercus intermedius*)、方背皮蝽、温带臭虫、长红猎蝽和椎猎蝽属。

20 同翅目: 例如, 甘蓝粉虱、甘薯粉虱、温室白粉虱、棉蚜、甘蓝蚜、茶藨隐瘤蚜、豆卫矛蚜、苹果蚜、苹果绵蚜、桃大尾蚜、葡萄根瘤蚜、瘿绵蚜属、麦长管蚜、瘤蚜属、忽布疣蚜、禾谷缢管蚜、绿小叶蝉属、秧叶蝉 (*Euscelis bilobatus*)、黑尾叶蝉、欧果坚球蚧、榄珠蜡蚧、灰飞虱、褐飞虱、红肾圆盾蚧、常春藤圆盾蚧、粉蚧属和木虱属。

25 鳞翅目: 例如, 棉红铃虫、松粉蝶尺蛾、果园秋尺蛾、潜叶细蛾 (*lithocolletis blancardella*)、苹果巢蛾、小菜蛾、黄褐天幕毛虫、黄毒蛾、毒蛾属、棉潜蛾 (*Bucculatrix thurberiella*)、柑橘潜叶蛾、地夜蛾属、切夜蛾属、脏切夜蛾、埃及钻夜蛾、实夜蛾属、甘蓝夜蛾、小眼夜蛾、灰翅夜蛾属、粉纹夜蛾、苹果蠹蛾、粉蝶属、禾草螟属、玉米螟、地中海粉斑螟、蜡螟、幕谷蛾、袋谷蛾、褐织蛾、黄尾卷叶蛾、烟卷蛾 (*Capua reticulana*)、云杉色卷蛾、葡萄果蠹

30

蛾、茶长卷蛾、栎绿卷蛾、Cnaphalocerus 属和水稻负泥虫。

鞘翅目：例如，家具窃蠹、谷蠹、豆象 (Bruchidius obtectus)、菜豆象、北美家天牛、蓝毛臀萤叶甲、马铃薯叶甲、辣根猿叶甲、条叶甲属、油菜金头跳甲、墨西哥豆瓢虫、隐食甲属、锯谷盗、花象属、米象属、葡萄黑耳喙象、香蕉根颈象、种子象、紫苜蓿叶象、皮蠹属、斑皮蠹属、圆皮蠹属、毛皮蠹属、粉蠹属、油菜花露尾甲、蛛甲属、黄蛛甲、麦蛛甲、拟谷盗属、黄粉甲、叩甲属、宽胸叩甲属、五月鳃金龟、马铃薯鳃金龟、褐新西兰肋翅鳃角金龟和稻水象。

膜翅目：例如，松叶蜂属、实叶蜂属、毛蚁属、小家蚁和胡蜂属。

双翅目：例如，伊蚊属、按蚊属、库蚊属、黄猩猩果蝇、家蝇属、厕蝇属、红头丽蝇、绿蝇属、金蝇属、疽蝇属、胃蝇属、虱蝇属、螫蝇属、狂蝇属、皮蝇属、虻属、塘螂属 (Tannia spp.)、花园毛蚊、瑞典麦杆蝇、草种蝇属、菠菜泉蝇、地中海实蝇、油橄榄果实蝇、沼泽大蚊、种蝇属和斑潜蝇属。

蚤目：例如，印鼠客蚤和角叶蚤属。

蛛形纲：例如，蝎 (Scorpio maurus)、红斑蛛、粗脚粉螨、锐缘婢属、纯缘婢属、鸡皮刺螨、兔瘰螨、柑橘皱叶刺瘰螨、牛婢属、扇头婢属、花婢属、璃眼婢属、硬婢属、瘰螨属、痒螨属、疥螨属、跗线螨属、苜蓿苔螨、全爪螨属、叶螨属、半跗线螨属和短须螨属。

植物寄生线虫包括，例如短体线虫属、相似穿孔线虫、起绒草茎线虫、半穿刺线虫、异皮属、球异皮属、根结属、滑刃线虫属、长针线虫属、剑线属、毛刺属和伞滑刃线虫属。

如需要，本发明化合物在特定的浓度和使用量下还可用作除草剂和杀微生物剂，例如作为杀真菌剂，抗霉菌剂和杀细菌剂。如需要，还可以作为合成其它活性化合物的中间体或前体。

根据本发明，可以处理所有植物和植物各部分。此处植物可以理解为所有植物以及植物群落，如需要和不需要的野生植物或作物 (包括自然长出的作物)。作物可以通过常规育种和优化方法或通过生物技术和遗传工程方法或上述方法的结合获得的植物，包括转基因植物以及包括获得或没有获得植物育种者证书 (Sortenschutzrechte) 保护的植物栽培品种。植物的各部分可理解为所有地上和地下部分以及植物组织，如茎、叶、花和根，可提及的实例为叶片、针叶、枝条、

树干、花、子实体、果实和种子以及根、块茎和根状茎。植物各部分还包括收获的植物和植物营养体以及有性繁殖材料，例如种苗、块茎、根状经、插条和种子。

5 使用本发明活性化合物进行植物和植物各部分的处理是通过常规处理方法直接施用或作用于它们的环境、生境或贮藏区进行处理，该常规处理方法例如浸渍、喷雾、熏蒸、弥雾、撒播、刷涂以及在繁殖材料特别是种子的情况下还可以进行一层或多层包衣。

10 本发明活性化合物可被转化成为常规的制剂，如液剂，乳剂，可湿性粉剂，悬浮剂，粉剂，细粉剂，糊剂，可溶粉剂，颗粒剂，浓悬浮乳剂，用活性化合物浸渍的天然和合成材料和在聚合物中的微胶囊。

这些制剂是以已知方法制备的，例如通过将活性化合物与填充剂，即液体溶剂和/或固体载体混合而生产，制剂中可任意选择地使用表面活性剂，即乳化剂和/或分散剂，和/或发泡剂。

15 在使用水作为填充剂的情况下，例如，也可使用有机溶剂作为助溶剂。适当的液体溶剂主要有：芳香烃类，如二甲苯，甲苯或烷基萘，氯代芳烃类和氯代脂肪烃类，如氯苯，二氯乙烷或二氯甲烷，脂肪烃类，如环己烷或链烷烃，例如石油馏份，矿物油和植物油，醇类，如丁醇或乙二醇及其醚和酯类，酮类，如丙酮，甲基乙基酮，甲基异丁基酮或环己酮，强极性溶剂，如二甲基甲酰胺和二甲基亚砷，以及水。

20 适当的固体载体有：例如，铵盐和天然矿物粉末，如高岭土，粘土，滑石，白垩，石英，硅镁土，蒙脱土或硅藻土，和合成矿物粉末，如高分散二氧化硅，氧化铝和硅酸盐；适合颗粒剂的固体载体有：例如，粉碎和分级的天然岩石，如方解石，大理石，浮石，海泡石和白云石，以及无机和有机粉末的合成颗粒，以及有机材料的颗粒，如锯末，坚果壳，玉米穗茎和烟草茎；适当的乳化剂和/或发泡剂有：例如非离子和阴离子乳化剂，如聚氧乙烯脂肪酸酯，聚氧乙烯脂肪醇醚，例如烷基芳基聚乙二醇醚，烷基磺酸盐，烷基硫酸盐，芳基磺酸盐以及蛋白水解产物；适合的分散剂有：例如亚硫酸化木素废液和甲基纤维素。

30 在制剂中还可使用粘着剂，如羧甲基纤维素和粉末、颗粒或胶乳状天然和合成聚合物，如阿拉伯树胶，聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯，以及天然磷脂，如脑磷脂和卵磷脂，和合成磷脂。其它的添加剂可以是矿物油和植物油。

可能使用的着色剂,如无机颜料,例如氧化铁,氧化钛和普鲁士兰,和有机染料,如茜素染料,偶氮染料和金属酞菁染料,和痕量营养物例如,铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

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

本发明活性化合物可以其市售制剂和从上述制剂制备的应用形式,以及与其它活性化合物的混合物的形式存在,其它活性化合物,如杀虫剂、引诱剂、消毒剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、植物生长调节剂或除草剂。例如,杀虫剂包括:磷酸酯、氨基甲酸酯、  
10 羧酸酯、氯代烃类、苯基脲类、从微生物中生产的物质等。

混合物中特别令人满意的共组分实例为下述化合物:

杀真菌剂:

Aldimorph, 氯丙膦酸, 氯丙膦酸钾盐, Andoprim, 敌菌灵, 氧环唑, 腈嘧菌酯,

15 苯霜灵, 麦锈灵, 苯菌灵, 苄烯酸, 苄烯酸异丁酯, 双丙氯膦, 乐杀螨, 联苯, 联苯三唑醇, 灭瘟素, 糠菌唑, 乙嘧酚磺酸酯, 丁硫啉,

石硫合剂, Capsimycin, 敌菌丹, 克菌丹, 多菌灵, 萎锈灵, Carvon, 灭螨锰, 灭瘟唑, 苯咪唑菌, 地茂散, 氯化苦, 百菌清, 乙菌利, Clozylacon, 硫杂灵, 霜脲氰, 环丙唑醇, 嘧菌环胺, 酯菌胺,

20 咪菌威, 双氯酚, 苄氯三唑醇, Diclofluanid, 吡菌酮, 氯硝胺, 乙霉威, 苯醚甲环唑, 二甲嘧酚, 烯酰吗啉, 烯唑醇, 烯唑醇-M, 敌螨普, 二苯胺, 吡菌硫, 灭菌磷, 二氯蒽醌, 十二环吗啉, 多果定, 敌菌酮,

敌瘟磷, 氧唑菌, 乙环唑, 乙嘧酚, 土菌灵,

25 噁唑酮菌, 咪菌腈, 氯苯嘧啶醇, 腈苯唑, 呋菌胺, 种衣酯, 拌种咯, 苯锈啉, 丁苯吗啉, 醋酸三苯锡, 羟基三苯锡, 福美铁, 嘧菌脒, 氟啶胺, 氟联苯菌, 氟氯菌核利, 氟唑唑, 呋嘧醇, 氟硅唑, 磺菌胺, 氟酰胺, 粉唑醇, 灭菌丹, 三乙膦酸铝, 三乙膦酸钠, 四氯苯酞, 麦穗宁, 呋霜灵, 呋吡唑灵, 灭菌胺, 呋菌唑, 呋醚唑, 拌种胺,

双胍盐,

30 六氯苯, 己唑醇, 恶霉灵,

抑霉唑, 亚胺唑, 双胍辛, 双八胍盐, 双胍辛醋酸盐, Iodocarb, 种菌唑, 异稻瘟净, 异菌脲, Irumamycin, 稻瘟灵, 氯苯咪菌酮,

春雷霉素, 亚胺菌, 含铜杀菌剂如: 氢氧化铜, 环烷酸铜, 王铜, 硫酸铜, 氧化铜, 喹啉铜和波尔多液,

代森锰铜, 代森锰锌, 代森锰, Meferimzone, 噻菌胺, 灭锈胺, 甲霜灵, 叶菌唑, 磺菌威, 吡菌胺, 代森联, 苯吡咯菌, 噻菌胺, 米多霉素, 腈菌唑, 甲菌利,

福镁镍, 异丙消, 氟苯嘧啶醇,

吡酰胺, 恶霜灵, Oxamocarb, 噻菌酮, 氧化萎锈灵, Oxyfenthin,

多效唑, 稻瘟酯, 戊菌唑, 戊菌隆, 氯瘟磷, 多马霉素, 啉丙灵, 多抗霉素, Polyoxorim, 烯丙苯噻唑, 咪鲜胺, 腐霉利, 霜霉威, Propanosine-sodium, 丙环唑, 丙森锌, 吡菌磷, 啉斑肟, 噻霉胺, 咯嗪酮, 氯吡吡醚,

Quinconazole, 五氯硝基苯,

硫和硫制剂,

戊唑醇, 叶枯酞, 四氯硝基苯, 四环唑, 四氯醚唑, 噻菌灵, 噻菌腈, 溴氯唑菌, 甲基硫菌灵, 福美双, 硫氯苯甲酰胺, 甲基立枯磷, 甲苯氯磺胺, 三唑酮, 三唑醇, 叶锈特, 咪唑嗪, 水杨菌胺, 三环唑, 十三吗啉, 氯菌唑, 嗪胺灵, 灭菌唑,

烯效唑,

有效霉素A, 乙烯菌核利, 烯霜芽唑,

氯菌胺, 代森锌, 福美锌, 以及

咪草酯 (Dagger G)

OK-8705,

OK-8801,

$\alpha$ -(1, 1-二甲基乙基)- $\beta$ -(2-苯氧基乙基)-1H-1, 2, 4-三唑-1-乙

醇,

$\alpha$ -(2, 4-二氯苯基)- $\beta$ -氟-b-丙基-1H-1, 2, 4-三唑-1-乙醇,

$\alpha$ -(2, 4-二氯苯基)- $\beta$ -甲氧基-a-甲基-1H-1, 2, 4-三唑-1-乙醇,

$\alpha$ -(5-甲基-1, 3-二噁烷-5-基)- $\beta$ -[[4-(三氟甲基)-苯基]-亚甲基]-1H-1, 2, 4-三唑-1-乙醇,

(5RS, 6RS)-6-羟基-2, 2, 7, 7-四甲基-5-(1H-1, 2, 4-三唑-1-基)-3-辛酮,

(E)-a-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-2-苯氧基-苯基乙酰胺,

{2-甲基-1-[[[1-(4-甲基苯基)-乙基]-氨基]-羰基]-丙基}-氨基甲酸1-异丙基酯,

1-(2,4-二氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-乙酮-0-(苯基甲基)-肟,

5 1-(2-甲基-1-萘基)-1H-吡咯-2,5-二酮,

1-(3,5-二氯苯基)-3-(2-丙烯基)-2,5-吡咯烷二酮,

1-[(二碘甲基)-磺酰基]-4-甲基-苯,

1-[[2-(2,4-二氯苯基)-1,3-二氧戊环-2-基]-甲基]-1H-咪唑,

1-[[2-(4-氯苯基)-3-苯基环氧乙烷基]-甲基]-1H-1,2,4-三

10 唑,

1-[1-[2-[(2,4-二氯苯基)-甲氧基]-苯基]-乙烯基]-1H-咪唑,

1-甲基-5-壬基-2-(苯基甲基)-3-吡咯烷醇,

2',6'-二溴-2-甲基-4'-三氟甲氧基-4'-三氟-甲基-1,3-噻唑-5-甲酰苯胺,

15 2,2-二氯-N-[1-(4-氯苯基)-乙基]-1-乙基-3-甲基-环丙烷甲酰胺,

2,6-二氯-5-(甲硫基)-4-嘧啶基-硫氰酸酯,

2,6-二氯-N-(4-三氟甲基苄基)-苯甲酰胺,

2,6-二氯-N-[[4-(三氟甲基)-苯基]-甲基]-苯甲酰胺,

20 2-(2,3,3-三碘-2-丙烯基)-2H-四唑,

2-[(1-甲基乙基)-磺酰基]-5-(三氟甲基)-1,3,4-噻二唑,

2-[[6-脱氧-4-O-(4-O-甲基-β-D-吡喃葡萄糖基)-α-D-吡喃葡萄糖基]-氨基]-4-甲氧基-1H-吡咯并[2,3-d]嘧啶-5-腈,

2-氨基丁烷,

25 2-溴-2-(溴甲基)-戊二腈,

2-氯-N-(2,3-二氢-1,1,3-三甲基-1H-茚-4-基)-3-吡啶甲酰胺,

2-氯-N-(2,6-二甲基苯基)-N-(异硫氰酸根合甲基)-乙酰胺,

2-苯基苯酚(OPP),

30 3,4-二氯-1-[4-(二氟甲氧基)-苯基]-1H-吡咯-2,5-二酮,

3,5-二氯-N-[氟基[(1-甲基-2-丙炔基)-氧基]-甲基]-苯甲酰胺,

- 3-(1,1-二甲基丙基-1-氧代-1H-茛-2-脲,  
3-[2-(4-氯苯基)-5-乙氧基-3-异噁唑烷基]-吡啶,  
4-氯-2-氟基-N,N-二甲基-5-(4-甲基苯基)-1H-咪唑-1-磺酰胺,  
5 4-甲基-四唑并[1,5-a]喹唑啉-5(4H)-酮,  
8-(1,1-二甲基乙基)-N-乙基-N-丙基-1,4-二氧杂螺[4.5]癸烷-2-甲胺,  
8-羟基喹啉硫酸盐,  
9H-咕吨-2-[(苯基氨基)-羰基]-9-甲酰胺,  
10 双-(1-甲基乙基)-3-甲基-4-[(3-甲基苯甲酰基)-氧基]-2,5-噻吩二甲酯,  
顺式-1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-环庚醇,  
顺式-4-[3-[4-(1,1-二甲基丙基)-苯基-2-甲基丙基]-2,6-二甲基-吗啉盐酸盐,  
15 [(4-氯苯基)-偶氮]-氟基乙酸乙酯,  
碳酸氢钾,  
甲四硫醇钠盐,  
1-(2,3-二氢-2,2-二甲基-1H-茛-1-基)-1H-咪唑-5-羧酸甲酯,  
N-(2,6-二甲基苯基)-N-(5-异噁唑基羰基)-DL-丙氨酸甲酯,  
20 N-(氯乙酰基)-N-(2,6-二甲基苯基)-DL-丙氨酸甲酯,  
N-(2,3-二氯-4-羟基苯基)-1-甲基-环己烷甲酰胺,  
N-(2,6-二甲基苯基)-2-甲氧基-N-(四氢-2-氧代-3-咪唑基)-乙酰胺,  
N-(2,6-二甲基苯基)-2-甲氧基-N-(四氢-2-氧代-3-噻吩基)-乙酰胺,  
25 乙酰胺,  
N-(2-氯-4-硝基苯基)-4-甲基-3-硝基-苯磺酰胺,  
N-(4-环己基苯基)-1,4,5,6-四氢-2-嘧啶胺,  
N-(4-己基苯基)-1,4,5,6-四氢-2-嘧啶胺,  
N-(5-氯-2-甲基苯基)-2-甲氧基-N-(2-氧代-3-噁唑烷基)-乙酰胺,  
30 胺,  
N-((6-甲氧基)-3-吡啶基)-环丙烷甲酰胺,  
N-[2,2,2-三氯-1-[(氯乙酰基)-氨基]-乙基]-苯甲酰胺,

N-[3-氯-4,5-双-(2-丙炔氧基)-苯基]-N'-甲氧基-甲亚氨酰胺  
(methanimidamid),

N-甲酰基-N-羟基-DL-丙氨酸钠盐,

[2-(二丙基氨基)-2-氧代乙基]-乙基硫代氨基磷酸 0,0-二乙

5 酯,

苯基丙基硫代氨基磷酸 0-甲基 S-苯基酯,

1,2,3-苯并噻二唑-7-硫代羧酸 S-甲酯,

螺[2H]-1-苯并吡喃-2,1'(3'H)-异苯并呋喃]-3'-酮,

杀细菌剂:

10 溴硝丙二醇、双氯酚、三氯甲基吡啶、福美镍、春雷霉素、辛噻  
酮、呋喃羧酸、土霉素、烯丙苯噻唑、链霉素、叶枯酞、硫酸铜和其  
它铜制剂。

杀虫剂/杀螨剂/杀线虫剂:

阿维菌素、乙酰甲胺磷、啉虫脒、氯丙菊酯、棉铃威、涕灭威、  
15 虱灭威、顺式氯氰菊酯、甲体氯氰菊酯、双甲脒、齐墩螨素、AZ 60541、  
艾扎丁、甲基吡啶磷、乙基谷硫磷、谷硫磷、三唑锡,

日本甲虫芽孢杆菌、球形芽孢杆菌、枯草芽孢杆菌、苏云金芽孢  
杆菌、Baculoviruses、蚕白僵菌、纤细白僵菌、恶虫威、丙硫克百  
威、杀虫磺、苯螨特、高效氯氰菊酯、联苯肼酯、联苯菊酯、

20 Bioethanomethrin、生物氯菊酯、仲丁威、溴硫磷 A、合杀威、噻嗪  
酮、特密硫磷、丁酮威、Butylpyridaben

硫线磷、甲萘威、克百威、三硫磷、丁硫克百威、杀螟丹、  
Chloethocarb、氯氧磷、氯唑虫清、毒虫畏、氯啉脒、氯甲磷、毒死  
蜱、甲基毒死蜱、Chlovaporthrin、顺式苜蓿菊酯、顺式氯菊酯、

25 Clocythrin、除线威、四螨嗪、杀螟腈、Cycloprene、乙氧菊酯、  
氯氧氯菊酯、氯氧氯菊酯、三环锡、氯氧菊酯、灭蝇胺

溴氧菊酯、甲基内吸磷、内吸磷硫赶式异构体、甲基内吸磷硫赶  
式异构体、丁醚脒、二嗪磷、敌敌畏、除虫脒、乐果、甲基毒虫畏、  
苯虫醚、乙拌磷、碘酞丁二辛、苯氧炔螨

30 Efusilanate、Emamectin、右旋烯炔菊酯、硫丹、虫霉属、S-  
氯戊聚酯、乙硫苯威、乙硫磷、灭线磷、醚菊酯、特苯噻唑、乙密硫  
磷

苯线磷、喹螨醚、苯丁锡、杀螟硫磷、苯硫威、Fenoxacrim、苯氧威、甲氧菊酯、Fenpyrad、Fenpyrithrin、唑螨酯、氰戊菊酯、氟虫腈、氟啶胺、啉胝脒、溴氰菊酯、氟环脒、氟氰戊菊酯、氟虫脒、Flutenzine、氟胺氰菊酯、地虫硫磷、丁苯硫磷、噻唑磷、

# 5 Fubfenprox、呋线威

颗粒体病毒

特丁苯酰肼、六六六、庚烯磷、氟铃脒、噻螨酮、烯虫乙酯、吡虫啉、氯唑磷、异柳磷、噁唑磷、齐墩螨素

核多角体病毒

# 10 高效氯氟氯菊酯、氯丙氧脒

马拉硫磷、灭蚜磷、四聚乙醛、甲胺磷、Metharhizium anisopliae、Metharhizium flavoviride、杀扑磷、甲硫威、灭多威、甲氧苯酰肼、速灭威、恶虫酮、速灭磷、米尔螨素、久效磷

二溴磷、烯啶虫胺、硝虫噻嗪、双苯氟脒

# 15 氧乐果、杀线威、亚砷磷

玫烟色拟青霉、对硫磷A、甲基对硫磷、氯菊酯、稻丰散、甲拌磷、伏杀硫磷、亚胺硫磷、磷胺、辛硫磷、抗蚜威、乙基嘧啶磷、甲基嘧啶磷、丙溴磷、猛杀威、残杀威、丙硫磷、发硫磷、吡蚜酮、吡唑硫磷、反灭虫菊、除虫菊素、哒螨灵、Pyridathion、嘧螨醚、蚊

# 20 蝇醚

喹硫磷

Ribavirin

杀抗松、硫线磷、氯硅菊酯、艾克敌 105、sulfotep、硫丙磷

# 25 氯胺氯菊酯、虫酰肼、吡螨胺、噻丙磷、氯苯脒、七氯菊酯、双硫磷、灭虫畏、特丁硫磷、杀虫畏、辛体氯氟氯菊酯、Thiamethoxam、噻丙腈、Thiatriphos、硫环杀、硫双威、久效威、敌贝特、溴氯氟菊酯、四溴菊酯、苯螨噻、唑蚜威、三唑磷、Thiazuron、氯咪唑、敌百虫、杀铃脒、混杀威

蚜灭多、氯吡啶虫、麦柯特尔

# 30 YI 5302

己体氯氟氯菊酯、Zolaprofos

(1R-顺)-[5-(苯基甲基)-3-呋喃基]-甲基-3-[(二氢-2-氧代-

- 3(2H)-亚呋喃基(furanyliden)-甲基]-2,2-二甲基环丙烷羧酸酯  
 (3-苯氧基苯基)-甲基-2,2,3,3-四甲基环丙烷羧酸酯  
 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]四氢-3,5-二甲基-N-硝基-1,3,5-三  
 嗪-2(1H)-亚胺
- 5 2-(2-氯-6-氟苯基)-4-[4-(1,1-二甲基乙基)苯基]-4,5-二氢-  
 噁唑  
 2-(乙酰氧基)-3-十二烷基-1,4-萘二酮  
 2-氯-N-[[[4-(1-苯基乙氧基)-苯基]-氨基]-羰基]-苯甲酰胺  
 2-氯-N-[[[4-(2,2-二氯-1,1-二氟乙氧基)-苯基]-氨基]-羰  
 基]-苯甲酰胺
- 10 3-甲基苯基-丙基氨基甲酸酯  
 4-[4-(4-乙氧基苯基)-4-甲基戊基]-1-氟-2-苯氧基-苯  
 4-氯-2-(1,1-二甲基乙基)-5-[[2-(2,6-二甲基-4-苯氧基苯氧  
 基)乙基]硫代]-3(2H)-吡嗪酮
- 15 4-氯-2-(2-氯-2-甲基丙基)-5-[(6-碘-3-吡啶基)甲氧基]-  
 3(2H)-吡嗪酮  
 4-氯-5-[(6-氯-3-吡啶基)甲氧基]-2-(3,4-二氯苯基)-3(2H)-  
 吡嗪酮  
 苏云金芽孢杆菌 EG-2348 株系
- 20 2-苯甲酰基-1-(1,1-二甲基乙基)-胂基苯甲酸,  
 2,2-二甲基-3-(2,4-二氯苯基)-2-氧代-1-氧杂螺[4,5]癸-3-  
 烯-4-基丁酸酯  
 [3-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-噻唑亚烷基]-氨基脒  
 二氢-2-(硝基亚甲基)-2H-1,3-噻嗪-3(4H)-甲醛
- 25 [2-[[1,6-二氢-6-氧代-(苯基甲基)-4-吡嗪基]氧基]乙基]-氨  
 基甲酸乙酯  
 N-(3,4,4-三氟-1-氧代-3-丁烯基)-甘氨酸  
 N-(4-氯苯基)-3-[4-(二氟甲氧基)苯基]-4,5-二氢-4-苯基-  
 1H-吡唑-1-甲酰胺
- 30 N-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-N'-甲基-N''-硝基-胍  
 N-甲基-N'-(1-甲基-2-丙烯基)-1,2-胂硫代二甲酰胺  
 (hydrazindicarbothioamid)

N-甲基-N'-2-丙烯基-1,2-胂硫代二甲酰胺

[2-(二丙基氨基)-2-氧代乙基]-乙基硫代氨基磷酸 0,0-二乙酯

还可与其它已知活性化合物,如除草剂或与肥料以及生长调节剂混合。

- 5 当用作杀虫剂时,本发明活性化合物可以其市售制剂和从上述制剂制备的应用形式,以及与增效剂的混合物的形式存在。增效剂是能够增加活性化合物活性的化合物,但加入的增效剂本身不是必须有活性。

10 从市售制剂制备的应用形式中活性化合物的含量可在很宽的范围内变化。使用形式中活性化合物的浓度为0.0000001至95重量%的活性化合物,优选0.0001至1重量%。

以适用于应用形式的常规方法进行使用。

15 当用于防治卫生害虫和储藏物品中的害虫时,活性化合物具有优异的木材和粘土残留活性以及对石灰底物上的碱具有很好的稳定性。

本发明活性化合物不仅对植物害虫、卫生害虫和储藏物品中的害虫具有活性,而且在兽医领域,对防治动物寄生虫(外寄生虫)也有活性,该寄生虫例如硬蜱、软蜱、兽疥癣螨、叶螨、蝇(叮咬和吸食)、寄生性蝇幼虫、虱、头虱、羽虱和跳蚤。这些寄生虫包括:

20 虱目,例如,血虱属、颚虱属、虱属、Pthirus spp.和管虱属;

食毛目以及钝角亚目和细角亚目,例如,毛羽虱属、Menopon spp.、巨毛虱属、羽虱属、Werneckiella spp.、Lepikentron spp.、畜虱属、嚼虱属和猫羽虱属;

25 双翅目以及长角亚目和短角亚目,例如,伊蚊属、按蚊属、库蚊属、蚋属、真蚋属、白蛉属、Lutzomyia spp.、库蠓属、斑虻属、瘤虻属、黄虻属、虻属、麻翅虻属、Philipomyia spp.、蜂虱蝇属、家蝇属、齿股蝇属、螫蝇属、角蝇属、莫蝇属、厕蝇属、舌蝇属、丽蝇属、绿蝇属、金蝇属、Wohlfahrtia spp.、麻蝇属、狂蝇属、皮蝇属、胃蝇属、虱蝇属、Lipoptena spp.、婢蝇属

30 蚤目,例如,蚤属、栉首蚤属、印鼠客蚤属、角叶蚤属

异翅亚目,例如,臭虫属、椎猎蝽属、红腹猎蝽属、全圆蝽属

蜚蠊目,例如,东方蜚蠊,美洲大蠊,德国小蠊和蜚蠊属

蜱螨目以及后气门亚目和中气门亚目,例如,锐缘蜱属、纯缘蜱属、残喙蜱属、硬蜱属、花蜱属、牛蜱属、革蜱属、*Haemophysalis* spp.、璃眼蜱属、扇头蜱属、皮刺螨属、刺利螨属、肺刺螨属、胸孔螨属和瓦螨属

- 5 辐螨亚目(前气门亚目)和粉螨目(无气门亚目),例如,蜂跗线螨属、姬螯螨属、禽螯厘螨属、肉螨属、疮螨属、蠕形螨属、恙螨属、牦螨属、粉螨属、食酪螨属、嗜木螨属、颈下螨属、翅螨属、瘰螨属、痒螨属、耳螨属、疥螨属、痂螨属、疣螨属、胞螨属和皮膜螨属。

- 10 本发明式(I)的活性化合物混剂也适用于防治侵扰农业家畜的节肢动物,农业家畜如牛、绵羊、山羊、马、猪、驴、骆驼、水牛、兔、鸡、火鸡、鸭、鹅和蜜蜂,其它家养动物,例如狗、猫、笼养鸟和水族馆的鱼,还有所谓的试验动物,例如田鼠、豚鼠、大鼠和小鼠。通过防治上述节肢动物,旨在减少动物死亡和减产(肉、奶、毛、皮、蛋、蜜等),因此,通过使用本发明的活性化合物可以使畜牧业更经济、更简单。

- 15 应用于兽医领域时,本发明的活性化合物可通过已知方法给药,即经肠给药,例如以片剂、胶囊剂、饮剂、灌药剂、颗粒剂、膏剂、大丸剂、喂食过程和栓剂等形式进行;非经肠给药,例如通过注射(肌肉注射、皮下注射、静脉注射、腹膜内注射等),植入法;经鼻给药;
- 20 经皮肤给药,例如以浸泡或洗浴、喷雾、泼上或擦上、洗涤和撒粉方式进行,也可借助于含有活性化合物的成型制品,例如项圈、耳饰物、尾饰物、肢环(带)、笼头、标志器具等。

- 25 当用于家畜,家禽,宠物等时,式(I)活性化合物可使用制剂形式(例如粉剂,乳剂,自流组合物),其中包括1-80重量%的活性化合物,直接使用或100-10000倍稀释后使用,或用作药浴。

另外发现本发明活性化合物还对损坏工业材料的昆虫具有很强的杀虫活性。

作为实例并优选列出下述昆虫,但并不限于此:

鞘翅目昆虫,如

- 30 北美家天牛、绿虎天牛(*Chlorophorus pilosis*)、家具窃蠹、报死材窃蠹、类翼窃蠹、*Dendrobium pertinex*、松芽枝窃蠹、松产品窃蠹(*Priobium carpini*)、褐粉蠹、粉蠹(*Lyctus africanus*)、

南方粉蠹、栎粉蠹、粉蠹(*Lyctus pubescens*)、胸粉蠹(*Trogoxylon aequale*)、鳞毛粉蠹、材小蠹属、条木小蠹属、咖啡黑长蠹、*Bostrychus capucins*、褐异翅长蠹、棘长蠹属、竹竿粉长蠹

膜翅目,例如

- 5 蓝黑树蜂、云杉大树蜂、泰加大树蜂、大树蜂(*Urocerus augur*)  
白蚁,例如

- 木白蚁(*Kaloterms flavicollis*)、麻头堆砂白蚁、印巴结构  
木异白蚁、欧美散白蚁、散白蚁(*Reticulitermes santonensis*)、  
散白蚁(*Reticulitermes lucifugus*)、达尔文澳白蚁、内华达古白  
10 蚁、台湾乳白蚁

缨尾目,例如台湾衣鱼

本发明的工业材料可以理解为表示非生活用品,例如优选塑料、  
胶粘剂、胶水、纸和板、皮革、木材和加工后的木制品和涂料组分。

- 木材以及加工后的木制品是特别需要优选保护其免受昆虫侵袭  
15 的材料。

通过本发明制剂或含有本发明制剂的混合物可以保护的木材和  
加工后的木制品可以理解为表示,例如:

- 建筑用木材、木梁、铁路轨枕、桥梁组件、船头、木制交通工具、  
箱子、货架、集装箱、电杆、木镶板、木窗和木门、胶合板、粗纸板、  
20 在房屋建筑或建筑细木工行业中常用的细木工或木制品。

活性化合物可直接,或以浓缩形式或常规制剂,如粉剂,颗粒剂,  
溶液,悬浮剂,乳剂或糊剂方式使用。

- 上述制剂可以以本身已知方法制备,例如通过将活性化合物与至  
少一种溶剂或稀释剂,乳化剂,分散剂和/或粘合剂或固定剂,抗水剂  
25 混合,如需要加入催干剂和UV稳定剂以及如需要加入染料和颜料,和  
其它加工助剂。

用于保护木材和建筑木材制品的杀虫组合物或浓缩物包含  
0.0001至95重量%,特别是0.001至60重量%的本发明活性化合物。

- 组合物或浓缩物的使用量是根据昆虫及其介质上的特性和发生  
30 情况而确定的。最佳施用量各自可通过系列试验确定。然而基于需保  
护的材料,一般,使用0.0001至20重量%,优选0.001至10重量%的活  
性化合物是足够的。

使用的溶剂和/或稀释剂是有机化学溶剂或溶剂混合物和/或低挥发性的油性或油类有机溶剂或溶剂混合物和/或极性有机溶剂或溶剂混合物和/或水,和如需要可加入乳化剂和/或湿润剂。

5 优选使用的有机溶剂是油性或油类溶剂,蒸发值大于35以及闪点大于30℃,并优选大于45℃。用作这类低挥发度的、不溶于水的油性和油类溶剂物质是适合的矿物油或它们的芳族馏分,或含有矿物油的溶剂混合物,优选石油溶剂,石油和/或烷基苯。

10 优选使用沸程为170-220℃的矿物油,沸程为170-220℃的石油溶剂,沸程为250-350℃的锭子油,沸程为160-280℃的石油或芳烃,以及松节油等。

在优选实施方案中,使用沸程为180-210℃的液体脂族烃或沸程为180-220℃的芳族和脂族烃的高沸点混合物和/或锭子油和/或一氯代萘,优选 $\alpha$ -一氯代萘。

15 蒸发值大于35以及闪点大于30℃并优选大于45℃的低挥发度的有机油性或油类溶剂可用高或中挥发度的有机溶剂部分替换,条件是溶剂混合物的蒸发值同样大于35以及闪点大于30℃并优选大于45℃,以及杀虫剂/杀菌剂混合物可溶或可乳化于该溶剂混合物中。

20 根据优选实施方案,某些有机化学溶剂或溶剂混合物用脂族极性有机化学溶剂或溶剂混合物替代。优选使用含有羟基和/或酯和/或醚基的脂族有机溶剂,例如乙二醇醚,酯等。

25 本发明使用的有机化学粘合剂是本身已知的合成树脂和/或已知的粘合干性油,它们可用水稀释和/或可溶解或分散或乳化于上述使用的有机化学溶剂中,特别是由下列物质组成或包含下列物质的的粘合剂:丙烯酸酯树脂,乙烯基树脂,例如聚乙酸乙烯酯,聚酯类树脂,缩聚树脂或聚加成反应树脂,聚氨酯树脂,醇酸树脂或改性的醇酸树脂,酚树脂,烃类树脂,如茛-香豆酮树脂,硅树脂,干性植物油和/或干性油和/或基于天然和/或合成树脂的物理干性粘合剂。

30 用作粘合剂的合成树脂可以以乳剂,分散剂或溶液形式使用。沥青或沥青状物质也可用作粘合剂,用量至多为10重量%。还可以使用本身已知的染料,颜料,防水剂,气味调节剂和抑制剂或防腐剂等。

在本发明组合物或浓缩物中优选包括作为有机化学粘合剂的至少一种醇酸树脂或改性醇酸树脂和/或一种干性植物油。本发明优选使用含油量大于45重量%，优选50-68重量%的醇酸树脂。

上述所有或某些粘合剂可用固定剂(混合物)或增塑剂(混合物)替代。加入这些添加剂的目的是防止活性化合物的蒸发以及结晶或沉淀。它们优选替代0.01至30%的粘合剂(以使用粘合剂的100%计)。

增塑剂选自苯二甲酸酯类的化学物质,如邻苯二甲酸二丁基,二辛基或苄基丁基酯,磷酸酯类如磷酸三丁酯,己二酸酯,如二-(2-乙基己基)己二酸酯,硬脂酸酯,如硬脂酸丁酯或硬脂酸戊酯,油酸酯,如油酸丁酯,甘油醚或高分子量的乙二醇醚,甘油酯和对甲苯磺酸酯。

固定剂在化学上基于聚乙烯烷基醚,如聚乙烯基甲基醚或酮,如二苯甲酮或亚乙基二苯甲酮。

适用的溶剂或稀释剂还特别是水,如需要可与一种或多种上述有机化学溶剂或稀释剂,乳化剂和分散剂混合使用。

15 对木材特别有效的保护方法是通过大批量的浸渍方法,例如通过真空,双真空 (Doppelvakuum) 或加压方法。

现混现用组合物中如需要还可以包含其它杀虫剂,以及如需要还可以含有一种或多种杀菌剂。

适合的添加的混合组分优选W094/29268中所提及的那些杀虫剂和杀菌剂。在该文献中所述化合物也作为本申请的明显组分。

特别优选的混合组分是杀虫剂如毒死蜱、辛硫磷、氟硅菊酯、顺式氯氰菊酯、氟氯氰菊酯、氯氰菊酯、溴氰菊酯、氯菊酯、吡虫啉、啉虫脒、氟虫脒、氟铃脒、四氯菊酯、thiacloprid、methoxyphenoxide 和杀铃脒。

25 以及杀菌剂,如氧唑菌、己唑醇、氧环唑、丙环唑、戊唑醇、环丙唑醇、叶菌唑、抑霉唑、抑菌灵、甲苯氟磺胺、3-碘-2-丙炔基-丁基氨基甲酸酯、N-辛基-异噻唑啉-3-酮和4,5-二氯-N-辛基异噻唑啉-3-酮。

30 本发明的化合物还可用于保护各种物品免受动植物的定殖,特别是经常与海水或微咸水接触的船壳、观测屏、网、船体结构、码头和信号装置。

由于定居性寡毛纲目,如龙介虫科以及甲壳类和Ledamorpha(茗荷儿)类,如各种茗荷属和铠茗荷属,或藤壶亚目(藤壶虫),如藤壶属或指茗荷属的定殖增加了船体的摩擦阻力并由于增加了能源消耗以及在干船坞上的轮班这样明显增加了运营成本。

5 此外定殖的还有海藻,例如水云属和仙菜属,特别重要是由定居性软甲亚纲(昆甲类)的附着侵染,该昆甲类包括在蔓足纲(蔓足类甲壳动物)中。

令人惊奇地,目前已发现本发明化合物单独使用或与其它活性化合物混合使用都具有很好的防污(抗定殖)作用。

10 通过使用本发明化合物,或单独使用或与其它活性化合物混合使用,可无需使用重金属,如,例如硫化二(三烷基锡)、月桂酸三正丁基锡、氯化三正丁基锡、一氧化铜、氯化三乙基锡、三正丁基(2-苯基-4-氯苯氧基)-锡、氧化三丁基锡、二硫化钼、氧化铈、聚合钛酸丁酯、氯化苯基-(联吡啶)-铋、氟化三正丁基锡、亚乙基二硫代氨基甲酸锰、二甲基二硫代氨基甲酸锌、亚乙基双硫代氨基甲酸锌、2-吡啶硫醇 1-氧化物的锌和铜盐、双二甲基二硫代氨基甲酰基 亚乙基双硫代氨基甲酸锌、氧化锌、亚乙基双二硫代氨基甲酸铜、硫氰酸铜、环烷酸铜和卤化三丁基锡,或显著降低上述化合物浓度。

15 如适合,现混现用防污漆还可包括其它活性化合物,优选杀藻剂、杀菌剂、除草剂、杀软体动物剂或其它防污活性化合物。

本发明的防污组合物中优选的共组分是:

杀藻剂,如

25 2-叔丁基氨基-4-环丙基氨基-6-甲硫基-1,3,5-三嗪、双氯酚、敌草隆、茵多酸、醋酸三苯基锡、异丙隆、甲基苯噻隆、乙氧氟草醚、灭藻醌和特丁净,

杀菌剂,如

环己基苯并[b]噻吩甲酰胺 S,S-二氧化物、抑菌灵、Fluorfolpet、3-碘-2-丙炔基 丁基氨基甲酸酯、甲苯氟磺胺和唑类,如

氧环唑、环丙唑醇、氧唑菌、己唑醇、叶菌唑、丙环唑和戊唑醇;

30 杀软体动物剂,如

醋酸三苯基锡、四聚乙醛、甲硫威、杀螺胺、硫双威和混杀威;或常用活性防污活性化合物,如

4, 5-二氯-2-辛基-4-异噻唑啉-3-酮、二碘甲基paratryl砒、  
2-(N,N-二甲硫基氨基甲酰基硫代)-5-硝基噻唑基、2-吡啶硫醇 1-  
氧化物的钾, 铜, 钠和锌盐、吡啶三苯基硼烷、四丁基二锡氧烷、  
2, 3, 5, 6-四氯-4-(甲磺酰基)-吡啶、2, 4, 5, 6-四氯间苯二氯、二硫  
5 化四甲基秋兰姆 (thiuram) 和2, 4, 6-三氯苯基马来酰亚胺。

使用的防污组合物中包含浓度为0.001至50重量%, 特别是0.01  
至20重量%的本发明活性化合物。

本发明防污组合物还包括在下述文献中公开的常用组分, 例  
如: Ungerer, Chem. Ind. 1985, 37, 730-732和Williams, Antifouling  
10 Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973。

除了杀藻、杀菌、杀软体动物和本发明的杀虫活性化合物外, 防  
污涂料组合物中还特别包括粘合剂。

公知的粘合剂的实例包括溶剂体系中的聚氯乙烯、溶剂体系中的  
氯化橡胶、溶剂体系特别是含水体系中的丙烯酸类树脂、水分散体形  
15 式或有机溶剂体系形式的氯乙烯/醋酸乙烯酯共聚物体系、丁二烯/  
苯乙烯/丙烯腈橡胶、干性油, 如亚麻子油, 树脂酯或与焦油或沥青、  
柏油以及环氧化合物、少量的氯化橡胶、氯化聚丙烯和乙烯基树脂混  
合形成的改性硬树脂。

涂料组合物还可任意选择地包括无机颜料、有机颜料或染料, 优  
20 选它们不溶于盐水。涂料组合物还可包括如松香类物质, 以使活性化  
合物可控制地释放。涂料中还可以包含增塑剂, 影响流变性质的改良  
剂, 以及其它常规组分。还可以将本发明化合物或上述混合物加入自  
抛光防污体系中。

活性化合物还适于控制封闭空间, 如公寓, 厂房, 办公室, 车厢等  
25 空间中出现的害虫, 特别是昆虫, 蜘蛛和螨。它们可单独使用或与其它  
活性化合物以及家用杀虫制剂中的常用助剂混合使用以防除害虫。它  
们对敏感和抗性种群以及所有发育阶段都有杀虫活性。这些害虫包  
括:

蝎目, 例如钳蝎 (*Buthus occitanus*)。

30 蟧螨目, 例如波斯锐缘蟧、翘缘锐缘蟧、苔蟧属、鸡皮刺蟧、家  
食甜蟧、非洲钝缘蟧、血红扇头蟧、恙蟧 (*Trombicula*  
*alfreddugesi*)、*Neutrombicula autumnalis*、屋尘蟧、粉尘蟧。



蛛形目,例如鸟蛤蛛科、园蛛科。

盲蛛目，例如拟蝎类 (Pseudoscorpiones chelifer)、Pseudoscorpiones cheiridium、Opiliones phalangium。

等足目，例如潮虫、鼠妇。

5 倍足目,例如具斑马陆、山蛩虫属。

唇足目，例如地蜈蚣属。

Zygentoma 目，例如栉衣鱼属、台湾衣鱼、Lepismodes  
inquilinus.

10 蜚蠊目，例如东方蜚蠊、德国小蠊、小蠊属 (*Blattella* *asahinai*)、马得拉蜚蠊、角腹蠊属、木蠊属、澳洲大蠊、美洲大蠊、褐斑大蠊、黑胸大蠊、长须蜚蠊。

跳跃亚目，例如家蟀。

革翅目，例如欧洲球螋。

等翅目，例如木白蚁属、散白蚁属。

15 啮虫目, 例如Lepinatus属、粉啮虫属。

鞘翅目,例如圓皮囊属、毛皮囊属、皮囊属、长头谷囊、隐跗郭公虫属、蛛甲属、谷囊、谷象、米象、玉米象、药材甲。

20 双翅目,例如埃及伊蚊、白纹伊蚊、*Aedes taeniorhynchus*、按蚊属、红头丽蝇、高额麻虻、致倦库蚊、尖音库蚊、*Culex tarsalis*、果蝇属、夏厕蝇、家蝇、白蛉属、麻蝇(*Sarcophaga carnaria*)、蚋属、厩螫蝇、大蚊(*Tipula paludosa*)。

鳞翅目,例如小蜡螟、蜡螟、印度古斑螟、谷蛾、袋谷蛾、幕谷蛾。

蚤目,例如犬栉首蚤、猫栉首蚤指名亚种、人蚤、穿皮潜蚤、印  
25 鼠客蚤。

膜翅目,例如广布弓背蚁、亮毛蚁、黑毛蚁、*Lasius umbratus*、小家蚁、*Paravespula*属、铺道蚁。

虱目，例如头虱、体虱、阴虱。

异翅亚目,例如热带臭虫、温带臭虫、长红猎蝽、侵扰锥猎蝽。

30 家用杀虫剂领域中,本发明化合物可单独使用或与其它适合的活性化合物混合使用,其它适合的活性化合物如磷酸酯类,氨基甲酸酯

类,拟除虫菊酯类,生长调节剂或选自其它已知各类杀虫剂的活性化合物。

它们可以使用气溶胶形式,非增压喷雾,例如通过泵、弥雾器、喷雾器、烟雾发生器、泡沫、凝胶、带有纤维素或塑料制成的汽化片的蒸发器、液体蒸发器、凝胶和薄膜蒸发器、推进式蒸发器、不需能量或被动式蒸发系统、防蛀纸、防蛀袋(Mottensäckchen)和防蛀胶作为颗粒剂或粉剂撒布饵料中或饵料位置。

本发明活性化合物可用作脱叶剂,干燥剂,除草剂,特别是除草剂。从广义上讲,杂草应理解为生长在不适合场所的所有植物。本发明物质是否用作灭生性或选择性除草剂基本上是根据其使用量而确定。

本发明的活性化合物例如可用于下述相关植物:

双子叶杂草属:苘麻属,苋属,豚草属,单花葵属,春黄菊属,Aphanes,滨藜属,雏菊属,鬼针草属,荠菜属,飞廉属,决明属,矢车菊属,藜属,蓟属,旋花属,曼陀罗属,金钱草,刺酸模属,糖芥属,大戟属,鼬瓣花属,牛膝菊属,猪殃殃属,木槿属,番薯属,地肤属,野芝麻属,独行菜属,母草属,母菊属,薄荷属,山靛属,Mullugo,勿忘草属,罂粟属,牵牛属,车前属,蓼属,马齿苋属,毛茛属,萝卜属,蔊菜属,水松叶属,酸模属,猪毛菜属,千里光属,田菁属,黄花稔属,欧白芥属,茄属,苦苣菜属,尖瓣花属,繁缕属,蒲公英属,遏蓝菜属,车轴草属,荨麻属,婆婆纳属,堇菜属,苍耳属。

双子叶作物属:花生属,甜菜属,芸苔属,黄瓜属,南瓜属,向日葵属,胡萝卜属,大豆属,棉属,甘薯属,莴苣属,亚麻属,番茄属,烟草属,菜豆属,豌豆属,茄属,巢菜属。

单子叶杂草属:山羊草属,冰草属,翦股颖属,看麦娘属,假翦股颖属,燕麦属,臂形草属,雀麦属,蒺藜草属,鸭跖草属,狗牙根属,莎草属,龙爪茅属,马唐属,稗属,荸荠属,蟋蟀草属,画眉草属,野黍属,羊茅属,飘拂草属,异蕊花属,白茅属,鸭嘴草属,千金子属,毒麦属,雨久花属,黍属,雀稗属,藨草属,梯牧草属,早熟禾属,筒轴茅属,慈菇属,蔗草属,狗尾草属,高粱属。

单子叶作物属:葱属,菠萝,天门冬属,燕麦属,大麦属,稻属,黍属,甘蔗属,黑麦属,高粱属,黑小麦,小麦,玉米属。



这些制剂是以已知方法生产的，例如，通过将活性成分与填充剂，即液体溶剂和/或固体载体混合而生产，制剂中可任意选择的可使用表面活性剂，即乳化剂和/或分散剂，和/或发泡剂。

5 在使用水作为填充剂的情况下，例如，也可使用有机溶剂作为助溶剂。适当的液体溶剂主要有：芳香烃类，如二甲苯，甲苯或烷基苯，氯代芳烃类和氯代脂肪烃类，如氯苯，二氯乙烷或二氯甲烷，脂肪烃类，如环己烷或链烷烃，例如石油馏份，矿物油和植物油，醇类，如丁醇或乙二醇及其醚和酯类，酮类，如丙酮，甲基乙基酮，甲基异丁基酮或环己酮，强极性溶剂，如二甲基甲酰胺和二甲基亚砷，以及水。

10 适当的固体载体有：例如，铵盐和天然矿物粉末，如高岭土，粘土，滑石，白垩，石英，硅镁土，蒙脱土或硅藻土，和合成矿物粉末，如高分散二氧化硅，氧化铝和硅酸盐；适合颗粒剂的固体载体有：例如，粉碎和分级的天然岩石，如方解石，大理石，浮石，海泡石和白云石，以及无机和有机粉末的合成颗粒，和有机材料的颗粒如锯末，坚果壳，玉米穗  
15 茎和烟草茎；适当的乳化剂和/或发泡剂有：例如非离子和阴离子乳化剂，如聚氧乙烯脂肪酸酯，聚氧乙烯脂肪醇醚，例如烷基聚乙二醇醚，烷基磺酸盐，烷基硫酸盐，芳基磺酸盐以及蛋白水解产物；适合的分散剂有：例如亚硫酸化木素废液和甲基纤维素。

20 在制剂中还可使用粘着剂，如羧甲基纤维素和粉末、颗粒或胶乳状天然和合成聚合物，如阿拉伯树胶，聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯，以及天然磷脂，如脑磷脂和卵磷脂，和合成磷脂。其它的粘着剂可以是矿物油和植物油。

25 可能使用的着色剂，如无机颜料，例如氧化铁，氧化钛和普鲁士兰，和有机染料，如茜素染料，偶氮染料和金属酞菁染料，和痕量营养物，例如，铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

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

30 在防治杂草时，本发明的活性化合物可以其本身或制剂形式使用，还可以与已知除草剂和/或改进与作物相容性的物质（“安全剂”）的混合物形式使用，这里，可用成品制剂或桶混形式。还可以与包含一种或多种已知除草剂和安全剂的除草剂混合。

对上述混合物而言可考虑的已知除草剂为,例如乙草胺、三氟羧草醚、苯草醚、甲草胺、禾草灭、莠灭净、amicarbazone、先甲草胺、酰嘧磺隆、莎稗磷、磺草灵、莠去津、唑啶炔草、四唑嘧磺隆、BAS-662H、beflubutamid、草除灵、呋草黄、苄嘧磺隆、噻草平、5 benzfendizone、benzobicyclon、吡草酮、新燕灵、双丙氨膦、甲羧除草醚、双草醚、溴丁酰草胺、溴酚脞、溴苯腈、丁草胺、butafenacil(-烯丙酯)、丁氧环酮、丁草敌、苯酮唑、酞脞草、双酰草胺、氟酮唑草、甲氧除草醚、草灭畏、氯草敏、氯嘧磺隆、草枯醚、氯磺隆、绿麦隆、cinidon(-乙酯)、环庚草醚、醚黄隆、clefoxydim、10 烯草酮、炔草酸、异恶草松、氯甲酰草胺、二氯吡啶酸、clopyrasulfuron(-甲酯)、唑嘧磺胺盐、cumyluron、氯草津、cybutryne、环草敌、环丙嘧磺隆、噻草酮、氯氯草酯、2,4-滴、2,4-滴丁酸、甜菜安、燕麦敌、麦草畏、精2,4-滴丙酸、禾草灵、唑嘧磺胺、乙酰甲草胺、野燕枯、吡氟酰草胺、二氯吡隆、噁唑隆、啉草丹、15 二甲草胺、异戊乙净、二甲吩草胺、dimexyflam、敌乐胺、双苯酰草胺、敌草快、氟硫草啶、敌草隆、杀草隆、epoprodan、扑草灭(EPTC)、戊草丹、乙丁烯氟灵、胺苯磺隆、乙氧呋草黄、ethoxyfen、乙氧嘧磺隆、乙苯酰草、精噁唑禾草灵、fentrazamide、麦草氟异丙酯、麦草氟异丙酯-L、麦草氟甲酯、啶嘧磺隆、florasulam、精吡氟禾草灵、20 fluazolate、flucarbazone(-钠盐)、flufenacet、氟唑啶草、氟烯草酸、丙炔氟草胺、flumipropyn、唑嘧磺草胺、氟草隆、氟咯草酮、乙羧氟草醚、氟胺草唑、flupropacil、flurpyrsulfuron(-甲酯,-钠盐)、苄丁酯、氟啶草酮、氯氟吡氧乙酸(-丁氧丙酯,-甲基庚基酯)、氟嘧醇、呋草酮、达草氟、噻唑草酰胺、氟磺胺草醚、foramsulfuron、25 草铵膦、草甘膦异丙胺盐、氟硝磺酰胺、氟吡乙禾灵、精氟吡甲禾灵、环嗪酮、咪草酯、imazamethapyr、咪草啶酸、imazapic、咪唑烟酸、咪唑喹啉酸、咪唑乙烟酸、咪吡嘧磺隆、iodosulfuron(-甲酯,钠盐)、碘苯腈、异丙乐灵、异丙隆、异恶隆、异噁草胺、isoxachlortole、异噁氟草、异恶草醚、乳氟禾草灵、环草啶、利谷隆、2甲4氯、2甲430 氯丙酸、苯噻酰草胺、mesotrione、苯噻草酮、吡唑草胺、甲基苯噻隆、吡喃隆、溴谷隆、( $\alpha$ -)异丙甲草胺、磺草唑胺、甲氧隆、嗪草酮、甲磺隆、禾草敌、绿谷隆、萘丙胺、敌草胺、草不隆、烟嘧磺隆、氟

草敏、坪草丹、氯磺乐灵、炔丙嘧唑草、恶草灵、环丙氧磺隆、氯嘧唑草、乙氧氟草醚、百草枯、壬酸、二甲戊灵、pendralin、戊唑草、甜菜宁、picolinafon、啶草磷、丙草胺、氟嘧磺隆、profluazol、扑草净、毒草胺、敌稗、恶草酸、异丙草胺、propoxycarbazon(-钠盐)、炔苯酰草胺、苄草丹、氟磺隆、氟唑草酯、pyrazogyl、吡唑特、吡嘧磺隆、苄草唑、pyribenzoxim、稗草丹、哒草特、pyridatol、pyriftalid、肟啶草、嘧草硫醚、二氯喹啉酸、氯甲喹啉酸、灭藻醌、精喹禾灵、喹禾糖酯、砒嘧磺隆、稀禾啶、西玛津、西草净、磺草酮、甲磺草胺、甲嘧磺隆、草硫磷、乙黄黄隆、牧草胺、丁噻隆、tepraloxydim、特丁津、特丁净、噻吩草胺、thiafluamide、噻唑烟酸、噻二唑胺、噻吩磺隆、禾草丹、仲草丹、三甲苯草酮、野麦畏、醚苯磺隆、苯磺隆、三氯吡氧乙酸、灭草环、氟乐灵、trifloxysulfuron、氟胺磺隆和tritosulfuron。

与其它已知活性化合物如杀真菌剂, 杀虫剂, 杀螨剂, 杀线虫剂, 驱鸟剂, 植物营养剂和土壤结构改良剂的混合物也是可能的。

本发明活性化合物可以其本身或其制剂形式,或进一步稀释制备的应用形式使用,如现用溶液,悬浮液,乳液,粉剂,糊剂或颗粒剂。可以常规方式使用上述制剂,例如泼浇,喷雾,弥雾,分散。

可在植物苗前和苗后使用本发明活性化合物。还可在播种前将活  
20 性化合物混入土壤。

使用的活性化合物的量可在较宽的范围内变化。这要根据所需作用的性质而确定。通常,用量为对每公顷表土使用 1g 至 10kg 活性化合物,优选每公顷 5g 至 5kg 活性化合物。

25 本发明化合物具有很强的杀微生物活性并可用于控制作物和各种材料中的不需要的微生物,如真菌和细菌。

作物保护中杀真菌剂可用于控制根肿菌纲、卵菌纲、壶菌纲、接合菌纲、子囊菌纲、担子菌纲和半知菌纲。

作物保护中杀细菌剂可用于控制假单胞菌科、根瘤菌科、肠杆菌科、棒杆菌科和链霉菌科。

30 可归入上述属名的引起真菌和细菌病害的某些病原物将以实例列于下面,但并不限于此:

黄单胞菌属,例如,野油菜黄单胞菌水稻致病变种;

- 假单胞菌属, 例如, 丁香假单胞菌黄瓜致病变种;  
 欧文氏菌属, 例如, 梨火疫病欧文氏菌;  
 腐霉属, 例如终极腐霉;  
 疫霉属, 例如蔓延疫霉;  
 5 假霜霉属, 例如菰草假霜霉或古巴假霜霉;  
 单轴霉属, 例如葡萄生单轴霉;  
 盘梗霉属, 例如莴苣盘梗霉;  
 霜霉属, 例如豌豆霜霉或芸苔霜霉;  
 白粉菌属, 例如禾白粉菌;  
 10 单丝壳菌属, 例如苍耳单丝壳菌;  
 柄球菌属, 例如苹果白粉病柄球菌;  
 黑星菌属, 例如苹果黑星菌;  
 核腔菌属, 例如圆核腔菌或麦类核腔菌  
 (分生孢子型: 德斯霉, 异名: 长蠕孢属);  
 15 旋孢霉属, 例如禾旋孢霉(小麦根腐病菌)  
 (分生孢子型: 德斯霉, 异名: 长蠕孢属);  
 单胞锈菌属, 例如疣顶单胞锈菌(菜豆单胞锈菌);  
 柄锈菌属, 例如隐匿柄锈菌;  
 核盘菌属, 例如油菜核盘菌;  
 20 腥黑粉菌属, 例如小麦网腥黑粉菌;  
 黑粉菌属, 例如裸黑粉菌(麦散黑粉菌)或燕麦黑粉菌;  
 薄膜革菌属, 例如佐佐木氏薄膜革菌;  
 梨孢霉属, 例如稻梨孢(稻瘟病菌);  
 镰孢属, 例如大刀镰孢;  
 25 葡萄孢属, 例如灰色葡萄孢;  
 壳针孢属, 例如颖枯壳针孢(小麦颖枯病菌);  
 小球腔菌属, 例如冰草颖枯病菌的有性阶段;  
 尾孢属, 例如 *Cerospora canescens*;  
 链格孢属, 例如甘蓝黑斑病链格孢; 以及  
 30 假尾孢属, 例如小麦眼斑(基腐病)菌;

由于当以控制植物病害所需量的浓度使用时, 植物对活性化合物具有很好的耐受性, 因此可用于处理植物的地上部分, 繁殖块茎和种

子以及土壤。

本发明活性化合物还可用于提高作物产量。另外，它们的毒性降低且植物具有很好的耐受性。

如需要，本发明活性化合物在一定浓度和使用量下，还可用作除草剂，用于调节植物生长以及用于控制害虫。如需要，还可用作合成其它活性化合物的中间体和前体。

用于保护材料时，本发明化合物可用于保护工业材料使之免受有害微生物的侵染和破坏。

在本发明中工业材料可以理解为表示在工业领域已制备使用的非生命物质。例如，使用本发明活性化合物可保护其免受微生物影响或破坏的工业材料可以是胶粘剂、胶水、纸和板、纺织品、皮革、木材、涂料和塑料制品、冷却润滑剂以及可被微生物侵染或破坏的其它材料。生产工厂的各部件，例如可受微生物增殖而破坏的冷却水循环系统也包括在需要保护的材料范围内。本发明范围内可提及的工业材料优选胶粘剂、胶水、纸和板、皮革、木材、涂料、冷却润滑剂和传热液体，特别优选木材。

可腐蚀或改变工业材料的微生物例如是细菌，真菌，酵母，藻和粘菌（Schleimorganismen）。本发明活性化合物或组合物优选杀真菌，特别是霉菌，使木材变色菌及木腐菌（担子菌纲），以及杀粘菌和藻类。

下列属的微生物作为实例提出：

链格孢属，例如纤细链格孢，

曲霉属，例如黑色曲霉，

毛壳霉属，例如球毛壳霉，

粉孢革菌属，例如单纯粉孢革菌，

香菇属，例如 *Lentinus tigrinus*，

青霉属，例如灰绿青霉，

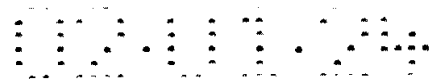
多孔菌属，例如变色多孔菌，

短柄霉属，例如出芽短柄霉，

*Sclerophoma*，例如 *Sclerophoma pityophila*，

木霉属，例如绿色木霉，

埃希氏杆菌属，例如大肠杆菌，



假单胞菌属,例如铜绿假单胞菌(绿脓杆菌),以及  
葡萄球菌属,例如金黄色葡萄球菌。

根据它们各自的物理和/或化学性质,可将活性化合物加工成常  
规制剂,例如溶液、乳剂、悬浮剂、粉剂、泡沫剂、糊剂、颗粒剂、  
5 气溶胶以及聚合物包封的微胶囊剂以及种子包衣剂,和超低容量  
(ULV)冷和热弥雾剂。

这些制剂是以已知方法生产的,例如,通过将活性成分与填充  
剂,即液体溶剂,加压液化气体,和/或固体载体混合而生产,制剂中可  
任意选择使用表面活性剂,即乳化剂和/或分散剂,和/或成泡剂。在使  
10 用水作为填充剂的情况下,例如,也可使用有机溶剂作为助溶剂。适当的  
液体溶剂主要有:芳香烃类,如二甲苯,甲苯或烷基苯,氯代芳烃类  
或氯代脂肪烃类,如氯苯,二氯乙烷或二氯甲烷,脂肪烃类,如环己烷  
或烷属烃,例如矿物油馏份,醇类,如丁醇或乙二醇及其醚和酯,酮类  
如丙酮,甲基乙基酮,甲基异丁基酮或环己酮,强极性溶剂,如二甲基  
15 甲酰胺和二甲基亚砷,以及水。液化气体填充剂或载体意为在标准温  
度和标准气压下是气体的加压液体,例如气雾推进剂如卤代烃类以及  
丁烷,丙烷,氮和二氧化碳。适当的固体载体有:例如,天然矿物粉末,  
如高岭土,粘土,滑石,白垩,石英,硅镁土,蒙脱土或硅藻土,和合成矿  
物粉末,如高分散二氧化硅,氧化铝和硅酸盐。适合颗粒剂的固体载  
20 体有:例如粉碎和分级的天然岩石如方解石,大理石,浮石,海泡石和  
白云石,或无机和有机的合成颗粒粉末,和有机材料的颗粒,如锯末,  
坚果壳,玉米穗茎和烟草茎。适当的乳化剂和/或成泡剂有:例如非离  
子和阴离子乳化剂,如聚氧乙烯脂肪酸酯,聚氧乙烯脂肪醇醚,例如烷  
基芳基聚乙二醇醚,烷基磺酸盐,烷基硫酸盐,芳基磺酸盐以及蛋白水  
25 解产物。适合的分散剂有:例如亚硫酸化木素废液和甲基纤维素。

在制剂中还可使用粘着剂,如羧甲基纤维素和粉末、颗粒或胶乳  
状合成聚合物,如阿拉伯树胶,聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯,以及天然磷  
脂,如脑磷脂和卵磷脂,和合成磷脂。其它的添加剂可以是矿物油和  
植物油。

30 可能使用的着色剂,如无机颜料,例如氧化铁,氧化钛和普鲁士兰,  
和有机染料,如茜素染料,偶氮染料和金属酞菁染料,和痕量营养物,  
例如,铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

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

本发明活性化合物可单独使用或与其它已知活性化合物的混合物的形式存在,其它活性化合物,如杀真菌剂,杀细菌剂,杀螨剂,杀线虫剂或杀虫剂,以使例如扩大活性谱或阻止抗性发展。在许多情况下,可获得增效作用,即混合物的活性超出单一组分活性。

混合物中共组分的实例包括下列化合物:

杀真菌剂:

aldimorph, 氯丙膦酸, 氯丙膦酸钾盐, andoprim, 敌菌灵, 氧环唑, 腈嘧菌酯,

苯霜灵, 麦锈灵, 苯菌灵, 苄烯酸, 苄烯酸异丁酯, 双丙氨膦, 乐杀螨, 联苯, 联苯三唑醇, 灭瘟素, 糠菌唑, 乙嘧酚磺酸酯, 丁硫啉,

石硫合剂, capsimycin, 敌菌丹, 克菌丹, 多菌灵, 萎锈灵, carvon, 灭螨锰, 灭瘟唑, 苯咪唑菌, 地茂散, 氯化苦, 百菌清, 乙菌利, clozylacon, 硫杂灵, 霜脍氰, 环丙唑醇, 嘧菌环胺, 酯菌胺,

咪菌威, 双氯酚, 苄氯三唑醇, diclofluanid, 哒菌酮, 氯硝胺, 乙霉威, 苯醚甲环唑, 二甲嘧酚, 烯酰吗啉, 烯唑醇, 烯唑醇-M, 敌螨普, 二苯胺, 吡菌硫, 灭菌磷, 二氯蒽醌, 十二环吗啉, 多果定, 敌菌酮,

敌瘟磷, 氧唑菌, 乙环唑, 乙嘧酚, 土菌灵,

噁唑酮菌, 咪菌腈, 氯苯嘧啶醇, 腈苯唑, 呋菌胺, 种衣酯, 拌种咯, 苯锈啉, 丁苯吗啉, 醋酸三苯锡, 羟基三苯锡, 福美铁, 嘧菌脲, 氯啉胺, 氯联苯菌, 氯氯菌核利, 氯喹唑, 呋嘧醇, 氯硅唑, 磺菌胺, 氯酰胺, 粉唑醇, 灭菌丹, 三乙膦酸铝, 三乙膦酸钠, 四氯苯酞, 麦穗宁, 呋霜灵, 呋吡唑灵, 灭菌胺, 呋菌唑, 呋醚唑, 拌种胺,

双胍盐,

六氯苯, 己唑醇, 恶霉灵,

抑霉唑, 亚胺唑, 双胍辛, 双八胍盐, 双胍辛醋酸盐, iodocarb, 种菌唑, 异稻瘟净, 异菌脲, irumamycin, 稻瘟灵, 氯苯咪菌酮,

春雷霉素, 亚胺菌, 含铜杀菌剂如: 氢氧化铜, 环烷酸铜, 王铜, 硫酸铜, 氧化铜, 喹啉铜和波尔多液,



1-(2,4-二氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-乙酮-0-(苯基甲基)-肟,

1-(2-甲基-1-萘基)-1H-吡咯-2,5-二酮,

1-(3,5-二氯苯基)-3-(2-丙烯基)-2,5-吡咯烷二酮,

5 1-[(二碘甲基)-磺酰基]-4-甲基-苯,

1-[[2-(2,4-二氯苯基)-1,3-二氧戊环-2-基]-甲基]-1H-咪唑,

1-[[2-(4-氯苯基)-3-苯基环氧乙烷基]-甲基]-1H-1,2,4-三唑,

1-[1-[2-[(2,4-二氯苯基)-甲氧基]-苯基]-乙烯基]-1H-咪唑,

10 1-甲基-5-壬基-2-(苯基甲基)-3-吡咯烷醇,

2',6'-二溴-2-甲基-4'-三氟甲氧基-4'-三氟-甲基-1,3-噻唑-5-甲酰苯胺,

2,2-二氯-N-[1-(4-氯苯基)-乙基]-1-乙基-3-甲基-环丙烷甲酰胺,

15 2,6-二氯-5-(甲硫基)-4-嘧啶基-硫氰酸酯,

2,6-二氯-N-(4-三氟甲基苄基)-苯甲酰胺,

2,6-二氯-N-[[4-(三氟甲基)-苯基]-甲基]-苯甲酰胺,

2-(2,3,3-三碘-2-丙烯基)-2H-四唑,

2-[(1-甲基乙基)-磺酰基]-5-(三氟甲基)-1,3,4-噻二唑,

20 2-[[6-脱氧-4-O-(4-O-甲基-β-D-吡喃葡萄糖基)-α-D-吡喃葡萄糖基]-氨基]-4-甲氧基-1H-吡咯并[2,3-d]嘧啶-5-腈,

2-氨基丁烷,

2-溴-2-(溴甲基)-戊二腈,

2-氯-N-(2,3-二氢-1,1,3-三甲基-1H-茛-4-基)-3-吡啶甲酰

25 胺,

2-氯-N-(2,6-二甲基苯基)-N-(异硫氰酸根合甲基)-乙酰胺,

2-苯基苯酚(OPP),

3,4-二氯-1-[4-(二氟甲氧基)-苯基]-1H-吡咯-2,5-二酮,

3,5-二氯-N-[氟基[(1-甲基-2-丙炔基)-氧基]-甲基]-苯甲酰

30 胺,

3-(1,1-二甲基丙基-1-氧代-1H-茛-2-腈,

3-[2-(4-氯苯基)-5-乙氧基-3-异噁唑烷基]-吡啶,

- 4-氯-2-氟基-N,N-二甲基-5-(4-甲基苯基)-1H-咪唑-1-磺酰胺,  
4-甲基-四唑并[1,5-a]喹唑啉-5(4H)-酮,  
8-(1,1-二甲基乙基)-N-乙基-N-丙基-1,4-二氧杂螺[4.5]癸烷  
5 -2-甲胺,  
8-羟基喹啉硫酸盐,  
9H-咕吨-2-[(苯基氨基)-羰基]-9-甲酰肼,  
双-(1-甲基乙基)-3-甲基-4-[(3-甲基苯甲酰基)-氧基]-2,5-噻吩二甲酸酯,  
10 顺式-1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-环庚醇,  
顺式-4-[3-[4-(1,1-二甲基丙基)-苯基-2-甲基丙基]-2,6-二甲基-吗啉盐酸盐,  
[(4-氯苯基)-偶氮]-氟基乙酸乙酯,  
碳酸氢钾,  
15 甲四硫醇钠盐,  
1-(2,3-二氢-2,2-二甲基-1H-茛-1-基)-1H-咪唑-5-羧酸甲酯,  
N-(2,6-二甲基苯基)-N-(5-异噁唑基羰基)-DL-丙氨酸甲酯,  
N-(氯乙酰基)-N-(2,6-二甲基苯基)-DL-丙氨酸甲酯,  
N-(2,3-二氯-4-羟基苯基)-1-甲基-环己烷甲酰胺,  
20 N-(2,6-二甲基苯基)-2-甲氧基-N-(四氢-2-氧代-3-咪唑基)-乙酰胺,  
N-(2,6-二甲基苯基)-2-甲氧基-N-(四氢-2-氧代-3-噻吩基)-乙酰胺,  
N-(2-氯-4-硝基苯基)-4-甲基-3-硝基-苯磺酰胺,  
25 N-(4-环己基苯基)-1,4,5,6-四氢-2-嘧啶胺,  
N-(4-己基苯基)-1,4,5,6-四氢-2-嘧啶胺,  
N-(5-氯-2-甲基苯基)-2-甲氧基-N-(2-氧代-3-噁唑烷基)-乙酰胺,  
N-((6-甲氧基)-3-吡啶基)-环丙烷甲酰胺,  
30 N-[2,2,2-三氯-1-[(氯乙酰基)-氨基]-乙基]-苯甲酰胺,  
N-[3-氯-4,5-双-(2-丙炔氧基)-苯基]-N'-甲氧基-甲亚氨酰胺,  
N-甲酰基-N-羟基-DL-丙氨酸钠盐,

[2-(二丙基氨基)-2-氧代乙基]-乙基硫代氨基磷酸 0,0-二乙酯,

苯基丙基硫代氨基磷酸 0-甲基 S-苯基酯,

1,2,3-苯并噻二唑-7-硫代羧酸 S-甲酯,

5 螺[2H]-1-苯并吡喃-2,1'(3'H)-异苯并呋喃]-3'-酮,

杀细菌剂:

溴硝丙二醇、双氯酚、三氯甲基吡啶、福美镍、春雷霉素、辛噻酮、呋喃羧酸、土霉素、烯丙苯噻唑、链霉素、叶枯酞、硫酸铜和其它铜制剂。

10 杀虫剂/杀螨剂/杀线虫剂:

阿维菌素、乙酰甲胺磷、啉虫脒、氟丙菊酯、棉铃威、涕灭威、虱灭威、顺式氯氟菊酯、甲体氯氟菊酯、双甲脒、齐墩螨素、AZ 60541、艾扎丁、甲基吡啶磷、乙基谷硫磷、谷硫磷、三唑锡,

15 日本甲虫芽孢杆菌、球形芽孢杆菌、枯草芽孢杆菌、苏云金芽孢杆菌、baculoviruses、蚕白僵菌、纤细白僵菌、恶虫威、丙硫克百威、杀虫磷、苯螨特、高效氯氟菊酯、联苯肼酯、联苯菊酯、bioethanomethrin、生物氯菊酯、仲丁威、溴硫磷 A、合杀威、噻嗪酮、特密硫磷、丁酮威、butylpyridaben

20 硫线磷、甲萘威、克百威、三硫磷、丁硫克百威、杀螟丹、chloroethocarb、氯氧磷、氯唑虫清、毒虫畏、氟啶脲、氯甲磷、毒死蜱、甲基毒死蜱、chlorvaphothrin、顺式苄呋菊酯、顺式氯菊酯、clopythrin、除线威、四螨嗪、杀螟腈、cycloprene、乙氧菊酯、氯氟菊酯、氯氟菊酯、三环锡、氯氟菊酯、灭蝇胺

25 溴氟菊酯、甲基内吸磷、内吸磷硫赶式异构体、甲基内吸磷硫赶式异构体、丁醚脲、二嗪磷、敌敌畏、除虫脲、乐果、甲基毒虫畏、苯虫醚、乙拌磷、碘酞丁二辛、苯氧炔螨

efusilanate、emamectin、右旋烯炔菊酯、硫丹、虫霉属、S-氟戊聚酯、乙硫苯威、乙硫磷、灭线磷、醚菊酯、特苯噻唑、乙密硫磷

30 苯线磷、啮螨醚、苯丁锡、杀螟硫磷、苯硫威、fenoxacrim、苯氧威、甲氧菊酯、fenpyrad、fenpyrithrin、啮螨酯、氟戊菊酯、氟虫腈、氟啶胺、啉蜱脲、溴氟菊酯、氟环脲、氟氟戊菊酯、氟虫脲、

flutenzine、氟胺氰菊酯、地虫硫磷、丁苯硫磷、噻唑磷、  
fubfenprox、呋线威

颗粒体病毒

- 5 特丁苯酞肼、六六六、庚烯磷、氟铃脲、噻螨酮、烯虫乙酯、吡  
虫啉、氯唑磷、异柳磷、噁唑磷、齐墩螨素

核多角体病毒

高效氯氟氰菊酯、氟丙氧脲

- 10 马拉硫磷、灭蚜磷、四聚乙醛、甲胺磷、Metharhizium  
anisopliae、Metharhizium flavoviride、杀扑磷、甲硫威、灭多  
威、甲氧苯酞肼、速灭威、恶虫酮、速灭磷、米尔螨素、久效磷

二溴磷、烯啶虫胺、硝虫噻嗪、双苯氟脲

氧乐果、杀线威、亚砷磷

- 15 玫烟色拟青霉、对硫磷 A、甲基对硫磷、氯菊酯、稻丰散、甲拌  
磷、伏杀硫磷、亚胺硫磷、磷胺、辛硫磷、抗蚜威、乙基嘧啶磷、甲  
基嘧啶磷、丙溴磷、猛杀威、残杀威、丙硫磷、发硫磷、吡蚜酮、吡  
唑硫磷、反灭虫菊、除虫菊素、哒螨灵、pyridathion、嘧螨醚、蚊  
蝇醚

啞硫磷

ribavirin

- 20 杀抗松、硫线磷、氟硅菊酯、艾克敌 105、sulfotep、硫丙磷

氟胺氰菊酯、虫酞肼、吡螨胺、嘧丙磷、氟苯脲、七氟菊酯、双  
硫磷、灭虫畏、特丁硫磷、杀虫畏、辛体氯氟菊酯、thiamethoxam、  
噻丙腈、thiatriphos、硫环杀、硫双威、久效威、敌贝特、溴氯氟  
菊酯、四溴菊酯、苯螨嗪、唑蚜威、三唑磷、thiazuron、氯咪唑、

- 25 敌百虫、杀铃脲、混杀威

蚜灭多、氟吡唑虫、麦柯特尔

YI 5302

己体氯氟菊酯、zolaprofos

- 30 (1R-顺)-[5-(苯基甲基)-3-呋喃基]-甲基-3-[(二氢-2-氧代-  
3(2H)-亚呋喃基)-甲基]-2,2-二甲基环丙烷羧酸酯

(3-苯氧基苯基)-甲基-2,2,3,3-四甲基环丙烷羧酸酯

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]四氢-3,5-二甲基-N-硝基-1,3,5-三

嗟-2(1H)-亚胺

2-(2-氯-6-氟苯基)-4-[4-(1,1-二甲基乙基)苯基]-4,5-二氢-  
噁唑

2-(乙酰氧基)-3-十二烷基-1,4-萘二酮

5 2-氯-N-[[[4-(1-苯基乙氧基)-苯基]-氨基]-羰基]-苯甲酰胺

2-氯-N-[[[4-(2,2-二氯-1,1-二氟乙氧基)-苯基]-氨基]-羰  
基]-苯甲酰胺

3-甲基苯基-丙基氨基甲酸酯

4-[4-(4-乙氧基苯基)-4-甲基戊基]-1-氟-2-苯氧基-苯

10 4-氯-2-(1,1-二甲基乙基)-5-[[2-(2,6-二甲基-4-苯氧基苯氧  
基)乙基]硫代]-3(2H)-吡嗪酮

4-氯-2-(2-氯-2-甲基丙基)-5-[(6-碘-3-吡啶基)甲氧基]-  
3(2H)-吡嗪酮

15 4-氯-5-[(6-氯-3-吡啶基)甲氧基]-2-(3,4-二氯苯基)-3(2H)-  
吡嗪酮

苏云金芽孢杆菌 EG-2348 株系

2-苯甲酰基-1-(1,1-二甲基乙基)-胼基苯甲酸,

2,2-二甲基-3-(2,4-二氯苯基)-2-氧-1-氧杂螺[4,5]癸-3-烯-  
4-基丁酸酯

20 [3-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-亚噻唑烷基]-氨基脒

二氢-2-(硝基亚甲基)-2H-1,3-噻嗪-3(4H)-甲醛

[2-[[1,6-二氢-6-氧代-(苯基甲基)-4-吡嗪基]氧基]乙基]-氨  
基甲酸乙酯

N-(3,4,4-三氟-1-氧代-3-丁烯基)-甘氨酸

25 N-(4-氯苯基)-3-[4-(二氟甲氧基)苯基]-4,5-二氢-4-苯基-  
1H-吡唑-1-甲酰胺

N-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-N'-甲基-N''-硝基-胍

N-甲基-N'-(1-甲基-2-丙烯基)-1,2-胼硫代二甲酰胺

N-甲基-N'-2-丙烯基-1,2-胼硫代二甲酰胺

30 [2-(二丙基氨基)-2-氧代乙基]-乙基硫代氨基磷酸 0,0-二乙酯  
还可与其它已知活性化合物,如除草剂或肥料以及生长调节剂混  
合。

此外,本发明式(I)化合物还具有很强的抗真菌活性。它们具有很宽的抗真菌活性谱,特别是抗皮肤真菌和酵母菌,霉菌和两阶段真菌(diphasic fungi)(例如抗假丝酵母属例如白色假丝酵母,Candida glabrata),表皮癣菌属,如絮状表皮癣菌,曲霉属,如黑色曲霉和烟曲霉,发癣菌属,如须发癣菌,小孢子菌属如犬小孢子菌和头癣小孢子菌。上述所列真菌并不表示限制于所覆盖的真菌谱,而是仅作为列举。

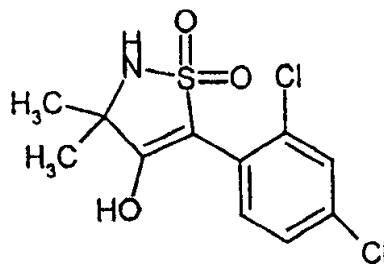
活性化合物可以其本身直接使用或以它们的制剂形式或由其制备的应用形式使用,如现混现用溶液,悬浮剂,可湿性粉剂,糊剂,可溶性粉剂,粉剂和颗粒剂。它们可以常规方式施用,例如泼浇,喷雾,弥雾,分散,粉化,形成泡沫,刷涂等方式。还可以将活性化合物通过超低容量方法施用或将活性化合物制剂,或活性化合物本身注入土壤。还可以用于处理植物种子。

当将本发明活性化合物用作杀真菌剂时,根据应用方式的不同,使用量可在较宽的范围内变化。在用于处理植物各部分时,一般活性化合物的使用量为0.1-10,000g/ha,优选10-1000g/ha。当处理种子时,一般活性化合物的使用量为每公斤种子0.001-50g,优选每公斤种子0.01-10g。在处理土壤时,一般活性化合物的使用量为0.1-10,000g/ha,优选1-5000g/ha。

通过下列实施例说明本发明制剂及其应用。

### 制备实施例

#### 实施例 I-1-a-1



#### 方法 A

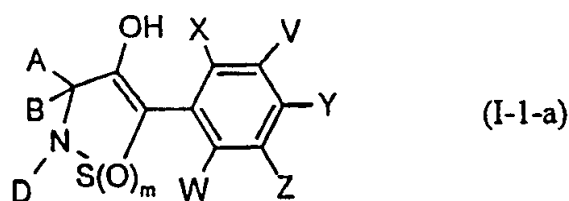
在20℃至40℃,将溶解在1ml无水二甲基甲酰胺(DMF)中的0.5g实施例 II-1 化合物,逐滴加入至含0.4g叔丁醇钾的1ml无水DMF溶

液中,将混合物在 40℃ 下进一步搅拌并通过薄层色谱控制反应进行。反应完成后,将 10ml 冰水加入反应混合物,反应混合物的温度为 0℃ 至 10℃,用浓盐酸酸化至 pH 2,然后抽吸过滤。将剩余物用冰水洗涤并用硅胶色谱纯化,使用二氯甲烷/乙酸乙酯 3:1 作为流动相。

5 产率:0.3g(约理论值的 64%),熔点 168℃。

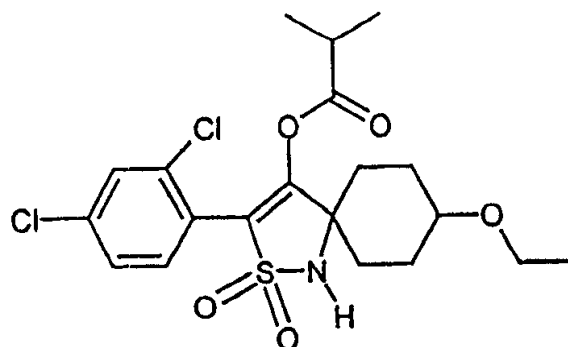
类似于实施例 I-1-a-1 和/或根据式 (I-1-a) 化合物制备方法的一般性描述可制备下列式 (I-1-a) 化合物。

表 1



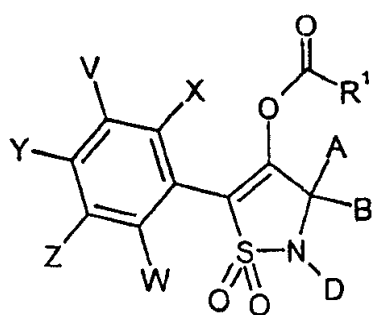
| 实施例号     | V  | W  | X               | Y               | Z | B                                                                                                     | A               | D               | m | 熔点 °C                      | 异构体 |
|----------|----|----|-----------------|-----------------|---|-------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------|-----------------|---|----------------------------|-----|
| I-1-a-2  | H  | Cl | Cl              | H               | H | CH <sub>3</sub>                                                                                       | CH <sub>3</sub> | H               | 2 | 112-114                    | -   |
| I-1-a-3  | F  | H  | F               | F               | F | CH <sub>3</sub>                                                                                       | CH <sub>3</sub> | H               | 2 | 112                        | -   |
| I-1-a-4  | H  | H  | Cl              | Cl              | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -               |                 | H               | 2 | 199                        | β   |
| I-1-a-5  | H  | H  | Cl              | Cl              | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                |                 | H               | 2 | 208                        | β   |
| I-1-a-6  | H  | Cl | Cl              | H               | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -               |                 | H               | 2 | 230                        | β   |
| I-1-a-7  | H  | Cl | Cl              | H               | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -               |                 | H               | 2 | 130                        | β   |
| I-1-a-8  | Cl | H  | H               | CF <sub>3</sub> | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -               |                 | H               | 2 | 149                        | β   |
| I-1-a-9  | H  | H  | Cl              | Cl              | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                 | H               | 2 | 173                        | β   |
| I-1-a-10 | H  | Cl | Cl              | H               | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                |                 | CH <sub>3</sub> | 2 | 250                        | β   |
| I-1-a-11 | H  | H  | H               | Cl              | H | H                                                                                                     |                 | H               | 2 | 182                        | -   |
| I-1-a-12 | H  | H  | NO <sub>2</sub> | H               | H | H                                                                                                     |                 | H               | 2 | MS/ESI<br>M 345<br>(100 %) | -   |
| I-1-a-13 | H  | H  | H               | Cl              | H | H                                                                                                     |                 | H               | 2 | 169-170                    | -   |
| I-1-a-14 | H  | H  | NO <sub>2</sub> | H               | H | H                                                                                                     |                 | H               | 2 | MS-ESI<br>M 379<br>(100 %) | -   |
| I-1-a-15 | H  | H  | Cl              | Cl              | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                 |                 | H               | 2 | 220                        | -   |
| I-1-a-16 | H  | H  | Cl              | Cl              | H | -CH <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub>                                                   |                 | H               | 2 | 189                        | -   |

# 实施例 I-1-b-1

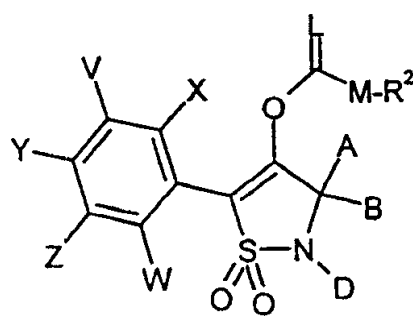


- 首先将 0.23g (0.59mmol) 的实施例 I-1-a-9 化合物加入到 2ml 无水二氯甲烷中, 然后加入 0.06g (0.59mmol) 的三乙胺并逐滴加入 0.065g (0.59mmol) 的异丁酰氯的 1ml 无水二氯甲烷溶液。将混合物回流搅拌过夜并用水洗涤, 用二氯甲烷抽提水相, 将合并的二氯甲烷相用  $\text{MgSO}_4$  干燥并浓缩, 将结晶状剩余物用洗涤用溶剂汽油搅拌。抽吸滤出固体并在空气中干燥。
- 10 产率: 0.135g (理论值的 49.5%), 熔点:  $112^\circ\text{C}$ 。

类似于实施例 I-1-b-1 方法制备下列式 (I-1-b) 和 (I-1-c) 化合物:



(I-1-b)

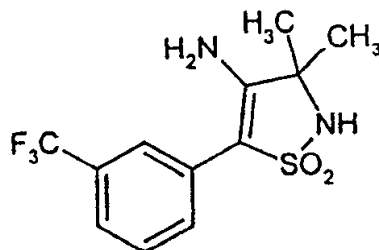


(I-1-c)

表 1'

| 实施例号    | V | W | X  | Y  | Z | R <sup>1</sup>                     | R <sup>2</sup>                                      | D | L | M | A                                                                            | B                                | 熔点 °C |
|---------|---|---|----|----|---|------------------------------------|-----------------------------------------------------|---|---|---|------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------|-------|
| I-1-b-1 | H | H | Cl | Cl | H | CH-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | -                                                   | H | - | - | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH-<br> <br>OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | 112°C |
| I-1-b-2 | H | H | Cl | Cl | H | CH-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | -                                                   | H | - | - | -CH <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                        |                                  | 120°C |
| I-1-b-3 | H | H | Cl | Cl | H | CH-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | -                                                   | H | - | - | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -        |                                  | 145°C |
| I-1-c-1 | H | H | Cl | Cl | H | -                                  | CH <sub>2</sub> -CH-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H | O | O | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH-<br> <br>OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | 124°C |
| I-1-c-2 | H | H | Cl | Cl | H | -                                  | CH <sub>2</sub> -CH-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H | O | O | -CH <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                        |                                  | 121°C |
| I-1-c-3 | H | H | Cl | Cl | H | -                                  | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                       | H | O | O | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -        |                                  | 162°C |
| I-1-c-4 | H | H | Cl | Cl | H | -                                  | CH <sub>2</sub> -CH-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H | O | O | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -        |                                  | 154°C |

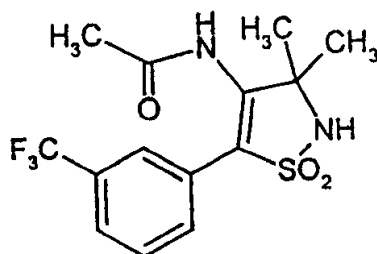
### 实施例 I-1-i-1



#### 方法 M-β

- 5        40℃下,将悬浮于5ml无水DMF中的5.5g实施例 XVIII-1 化合物逐滴加入至5g叔丁醇钾的30ml无水DMF中,并将混合物在60℃下搅拌2小时。减压蒸馏出溶剂并用水溶解剩余物,并将搅拌至200ml 20%盐酸中,抽吸滤出并干燥。将剩余物用硅胶色谱纯化,使用二氯甲烷/乙酸乙酯 5:3 作为流动相。
- 10      产率:2.3g(约理论值的42%),熔点 175℃。

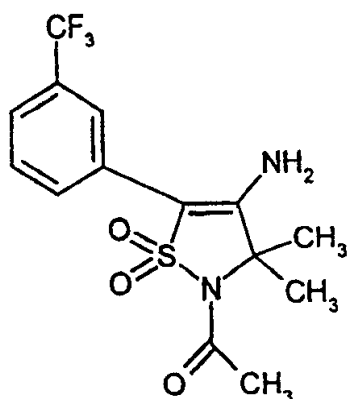
### 实施例 I-1-i-2



#### 方法 N-α

- 15        将0.51g化合物(I-1-i-1)与0.15g乙酰氯和0.2g乙酸酐的20ml无水甲苯溶液加热至60℃,并通过薄层色谱监控反应过程。减压蒸馏掉溶剂并将剩余物用硅胶色谱纯化,使用二氯甲烷/乙酸乙酯 5:3 作为流动相。
- 产率:0.35g(约理论值的61%),熔点 196℃。

### 实施例 I-1-i-3

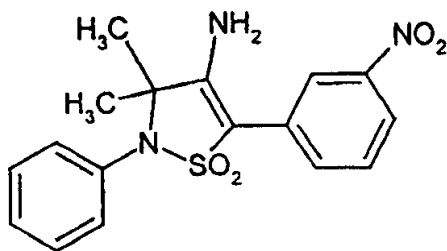


#### 方法 0

- 5        0℃下, 将 0.35g 化合物 (I-1-i-1) 的 30ml 无水四氢呋喃 (THF) 溶液逐滴加入至 0.04g 氢化钠 (60%) 的 10ml 无水 THF 混合物中。然后在 20℃下, 逐滴加入 0.1g 乙酰氯, 然后将混合物在 20℃下搅拌, 通过薄层色谱监控反应过程。小心地将混合物与水混合并用二氯甲烷抽提, 将抽提物干燥并浓缩。剩余物用硅胶色谱纯化, 使用二氯甲烷/乙酸乙酯 3:1 作为流动相。

10        产率: 0.35g (约理论值的 99%), 熔点 142℃。

### 实施例 I-1-i-4

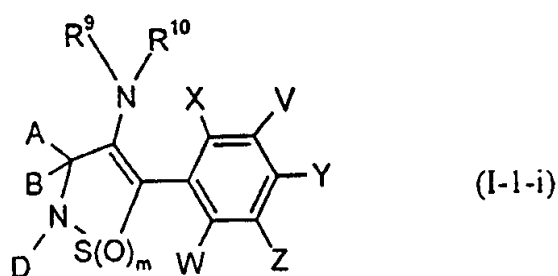


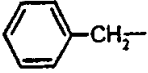
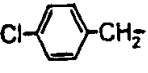
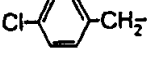
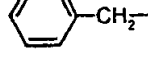
- 15        首先将 1.4g 化合物 (XVIII-1'-9) 加入 100ml 乙腈中。然后加入 0.93g 苄基溴和 1.02g 碳酸钾, 将混合物回流加热 22 小时。抽吸滤出沉淀, 浓缩滤液并将剩余物用醚/丙酮搅拌, 抽吸滤出并干燥。

产率: 1.1g (约理论值的 59%), 熔点 190℃。

- 20        类似于实施例 (I-1-i-1) 至 (I-1-i-4) 和/或根据式 (I-1-i) 化合物制备方法的一般性描述可制备下列式 (I-1-i) 化合物:

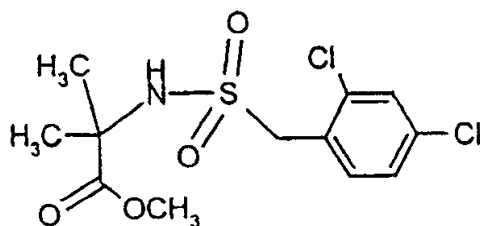
表 2



| 实施<br>例号 | V               | W  | X  | Y                | Z | B               | A               | D                                                                                    | m | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup>    | 熔点<br>°C |
|----------|-----------------|----|----|------------------|---|-----------------|-----------------|--------------------------------------------------------------------------------------|---|----------------|--------------------|----------|
| I-1-i-5  | CF <sub>3</sub> | H  | H  | Cl               | H | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                                                                                    | 2 | H              | H                  | 173      |
| I-1-i-6  | H               | Cl | Cl | CF <sub>3</sub>  | H | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                                                                                    | 2 | H              | H                  |          |
| I-1-i-7  | H               | H  | Cl | Cl               | H | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                                                                                    | 2 | H              | H                  | 228      |
| I-1-i-8  | H               | H  | Cl | Cl               | H | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                                                                                    | 2 | H              | CO-CH <sub>3</sub> | 230      |
| I-1-i-9  | H               | H  | Cl | Cl               | H | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> CO-                                                                  | 2 | H              | H                  | >250     |
| I-1-i-10 | H               | H  | H  | OCF <sub>3</sub> | H | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> |  | 2 | H              | H                  | 182      |
| I-1-i-11 | H               | H  | H  | OCF <sub>3</sub> | H | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> |  | 2 | H              | H                  | 195      |
| I-1-i-12 | NO <sub>2</sub> | H  | H  | H                | H | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> |  | 2 | H              | H                  | 180      |
| I-1-i-13 | H               | H  | H  | F                | H | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> |  | 2 | H              | H                  | 162      |

## 实施例 II-1

5

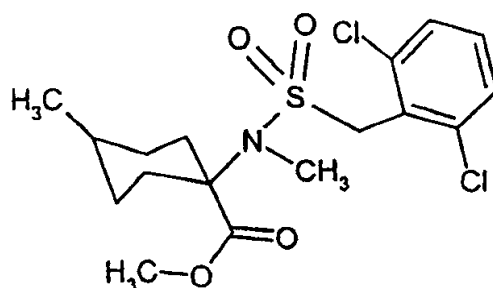


首先将 3.04g 氨基异丁酸甲基酯的盐酸盐加入 50ml 无水四氢呋喃 (THF) 中。加入 5.6ml 三乙胺后, 逐滴加入 2.6g 溶解在 10ml 无水

THF 中的 2,4-二氯苄基磺酰氯, 并将混合物在室温下搅拌 1 小时。将反应混合物倾入 200ml 1N 盐酸中并用二氯甲烷抽提, 将抽提物干燥并蒸馏掉溶剂。剩余物用硅胶色谱纯化, 使用乙酸乙酯/正己烷 2:1 作为流动相。

5 产率: 0.68g (理论值的 24%), 熔点: 84℃。

### 实施例 II-2



10 在室温下, 首先将 0.04g (0.94mmol) 的氢化钠 (60%) 加入 2ml 无水二甲基甲酰胺中, 并加入已溶解于 1ml 无水二甲基甲酰胺中的 0.37g (0.94mmol) 的 1-[[[(2,6-二氯苄基)甲基]磺酰基]-氨基]-4-甲基环己烷羧酸甲酯。将混合物在室温下搅拌 10 分钟, 然后逐滴加入 0.2g (1.41mmol) 的甲基碘, 并将混合物在室温下搅拌过夜。将混合物倾入冰水中并用浓盐酸调节使之偏酸性, 然后抽吸滤出固体并在空气中干燥。

15 产率: 0.325g (理论值的 84.8%)

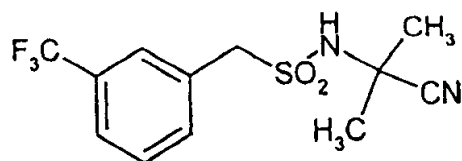
熔点: 100℃。

类似于实施例 II-1 和 II-2 和/或根据对式 (II) 化合物制备方法的一般性描述制备下列式 (II) 化合物:





# 实施例 XVIII-1'-1



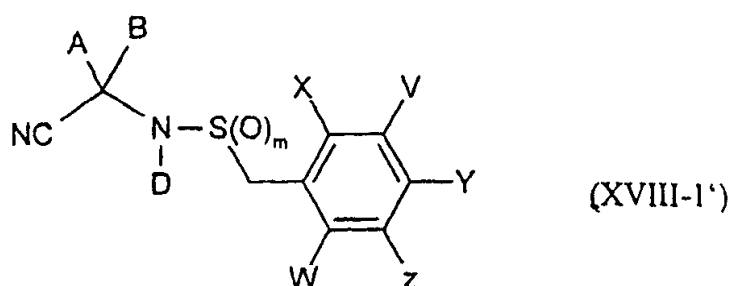
首先将 1.7g 2-氨基-异丁腈加入 40ml 无水四氢呋喃(THF)中。

- 5 加入 2.8ml 三乙胺,然后在 0℃下逐滴加入已溶解于 10ml 无水 THF 中的 5g 3-三氟甲基苄基磺酰氯。将混合物在 20℃下搅拌 1 小时,然后搅拌加入 200ml 1N 盐酸并抽提,干燥抽提物并减压蒸发掉溶剂。剩余物用硅胶色谱纯化,使用己烷/乙酸乙酯 7:3 作为流动相。

产率:6.1g(=理论值的 99%),熔点:107℃。

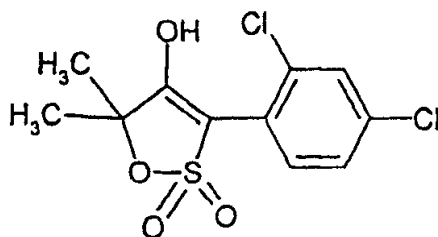
- 10 类似于实施例 (XVIII-1'-1) 和/或根据对式 (XVIII-1') 化合物制备方法的一般性描述制备下列化合物:

表 4



| 实施例号        | V               | W  | X               | Y                | Z | B                                  | A               | D | m | 熔点 °C |
|-------------|-----------------|----|-----------------|------------------|---|------------------------------------|-----------------|---|---|-------|
| XVIII-1'-2  | H               | H  | Cl              | Cl               | H | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub> | H | 2 | 138   |
| XVIII-1'-3  | H               | Cl | Cl              | CF <sub>3</sub>  | H | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub> | H | 2 | 128   |
| XVIII-1'-4  | H               | H  | CF <sub>3</sub> | H                | H | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub> | H | 2 |       |
| XVIII-1'-5  | CF <sub>3</sub> | H  | H               | Cl               | H | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub> | H | 2 |       |
| XVIII-1'-6  | H               | H  | Cl              | Cl               | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - |                 | H | 2 |       |
| XVIII-1'-7  | H               | Cl | Cl              | H                | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - |                 | H | 2 | 188   |
| XVIII-1'-8  | H               | H  | H               | OCF <sub>3</sub> | H | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub> | H | 2 | 126   |
| XVIII-1'-9  | NO <sub>2</sub> | H  | H               | H                | H | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub> | H | 2 | 135   |
| XVIII-1'-10 | H               | H  | H               | F                | H | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub> | H | 2 | 01    |

# 实施例 I-2-a-1



## 方法 B

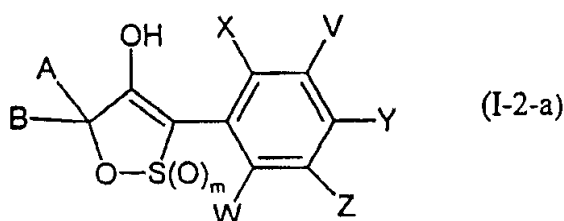
- 5 首先将 0.73g (18.2mmol) 的氢化钠 (60%) 加入 4ml 无水二甲基甲酰胺中, 将混合物冷却至 0℃ 并逐滴加入实施例 (III-1) 的 3.1g (9.1mmol) 的 2-[[ (2,4-二氯苄基) 磺酰基] 氧基]-2-甲基丙酸甲酯的 5ml 无水二甲基甲酰胺溶液。将混合物在室温下搅拌过夜, 然后倾置于冰上, 用浓盐酸酸化并用二氯甲烷反复抽提。用硫酸镁干燥抽
- 10 提物并浓缩, 获得黄色油状的化合物 I-2-a-1。

产率: 2g (理论值的 71%)

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  = 1.65, s, 6H (2 x  $\text{CH}_3$ ); 7.49, dd, 1H; 7.55, dd, 1H; 7.81, d, 1H; 12.6, bs, 1H;

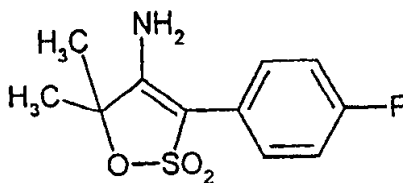
- 类似于实施例 I-2-a-1 和/或根据对式 (I-2-a) 化合物制备方法
- 15 的一般性描述制备下列式 (I-2-a) 化合物:

表 5



| 实施例号     | V               | W  | X  | Y               | Z | A                                                                                                     | B               | m | 熔点 °C |
|----------|-----------------|----|----|-----------------|---|-------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------|---|-------|
| I-2-a-2  | H               | H  | H  | CF <sub>3</sub> | H | CH <sub>3</sub>                                                                                       | CH <sub>3</sub> | 2 | 90    |
| I-2-a-3  | NO <sub>2</sub> | H  | H  | H               | H | CH <sub>3</sub>                                                                                       | CH <sub>3</sub> | 2 | 83    |
| I-2-a-4  | H               | H  | F  | CF <sub>3</sub> | H | CH <sub>3</sub>                                                                                       | CH <sub>3</sub> | 2 | 70    |
| I-2-a-5  | F               | F  | F  | F               | H | CH <sub>3</sub>                                                                                       | CH <sub>3</sub> | 2 | 油     |
| I-2-a-6  | CF <sub>3</sub> | H  | H  | Cl              | H | CH <sub>3</sub>                                                                                       | CH <sub>3</sub> | 2 | 油     |
| I-2-a-7  | H               | Cl | Cl | H               | H | CH <sub>3</sub>                                                                                       | CH <sub>3</sub> | 2 | 200   |
| I-2-a-8  | H               | H  | Cl | Cl              | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -               |                 | 2 | 油     |
| I-2-a-9  | H               | H  | Cl | Cl              | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                |                 | 2 | 油     |
| I-2-a-10 | H               | H  | Cl | Cl              | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                 | 2 | 油     |
| I-2-a-11 | H               | Cl | Cl | H               | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                |                 | 2 | 油     |
| I-2-a-12 | H               | Cl | Cl | H               | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -               |                 | 2 | 248   |

### 实施例 I-2-i-1



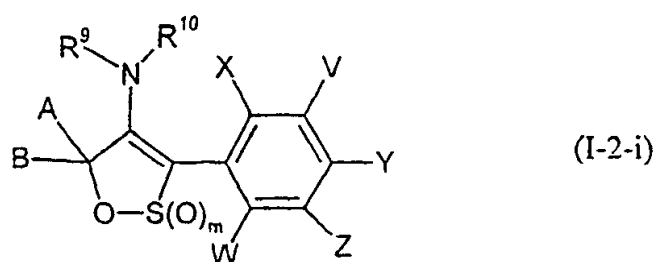
5

首先将 4g 化合物 XVIII-2'-1 加至 25ml 乙腈中。加入 0.24g 二氮杂双环十一碳烯 (DBU) 后, 将混合物加温至 32℃。再在室温下持续搅拌 7 小时, 然后浓缩混合物。将剩余物悬浮于甲苯/二异丙基醚中, 抽吸滤出并干燥。

10 产率: 3.6g (约理论值的 90%), 熔点 201℃。

类似于实施例 I-2-i-1 和/或根据对式 (I-2-i) 化合物制备方法的一般性描述制备下列式 (I-2-i) 化合物:

表 6

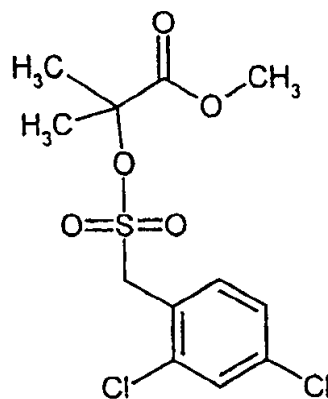


| 实施例号    | V               | W | X | Y                | Z | A               | B               | R <sup>9</sup> | R <sup>10</sup> | 熔点<br>°C |
|---------|-----------------|---|---|------------------|---|-----------------|-----------------|----------------|-----------------|----------|
| I-2-i-2 | CF <sub>3</sub> | H | H | H                | H | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | H               | 181      |
| I-2-i-3 | H               | H | H | OCF <sub>3</sub> | H | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | H               | 126      |
| I-2-i-4 | NO <sub>2</sub> | H | H | H                | H | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | H               | 186      |

其中 m=2

## 实施例 III-1

5



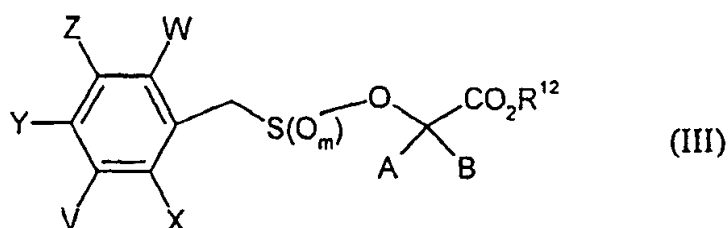
在 0℃ 下, 首先将 1.24g (10.5mmol) 的 2-羟基异丁酸甲酯加至 11ml 吡啶中, 分多次每次少量加入 3g (11.5mmol) 的 2,4-二氯苄基磺酰氯。将混合物保持在 5℃ 的冰箱中 2 天, 然后倾置于 50g 冰上, 加入 10.5g 浓硫酸, 用甲基叔丁基醚抽提混合物, 并用硫酸镁干燥抽提物然后浓缩, 获得油状化合物 III-1。

产率: 3.22g (理论值的 81.6%)

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta = 1.7$ , s, 6H ( $2 \times \text{CH}_3$ ); 3.75, s, 3H ( $\text{OCH}_3$ ); 4.67, s, 2H ( $\text{CH}_2$ ); 7.28, dd, 1H; 7.5, m, 2H;

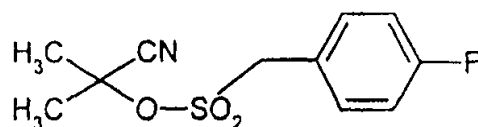
类似于实施例 III-1 和/或根据对式 (III) 化合物制备方法的一般性描述制备下列式 (III) 化合物。

5 表 7



| 实施例号   | V               | W  | X  | Y               | Z | A                                                                                                   | B               | m | R <sup>12</sup>               | 熔点 °C |
|--------|-----------------|----|----|-----------------|---|-----------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------|---|-------------------------------|-------|
| III-2  | H               | H  | H  | CF <sub>3</sub> | H | CH <sub>3</sub>                                                                                     | CH <sub>3</sub> | 2 | CH <sub>3</sub>               | 油     |
| III-3  | NO <sub>2</sub> | H  | H  | H               | H | CH <sub>3</sub>                                                                                     | CH <sub>3</sub> | 2 | CH <sub>3</sub>               | 油     |
| III-4  | H               | H  | F  | CF <sub>3</sub> | H | CH <sub>3</sub>                                                                                     | CH <sub>3</sub> | 2 | CH <sub>3</sub>               | 油     |
| III-5  | F               | F  | F  | F               | H | CH <sub>3</sub>                                                                                     | CH <sub>3</sub> | 2 | CH <sub>3</sub>               | 油     |
| III-6  | CF <sub>3</sub> | H  | H  | Cl              | H | CH <sub>3</sub>                                                                                     | CH <sub>3</sub> | 2 | CH <sub>3</sub>               | 油     |
| III-7  | H               | Cl | Cl | H               | H | CH <sub>3</sub>                                                                                     | CH <sub>3</sub> | 2 | CH <sub>3</sub>               | 97.5  |
| III-8  | H               | H  | Cl | Cl              | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>               |                 | 2 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 油     |
| III-9  | H               | H  | Cl | Cl              | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>                |                 | 2 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 油     |
| III-10 | H               | H  | Cl | Cl              | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> |                 | 2 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 油     |
| III-11 | H               | Cl | Cl | H               | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>                |                 | 2 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 油     |
| III-12 | H               | Cl | Cl | H               | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>               |                 | 2 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 99    |

### 实施例 XVIII-2'-1



10

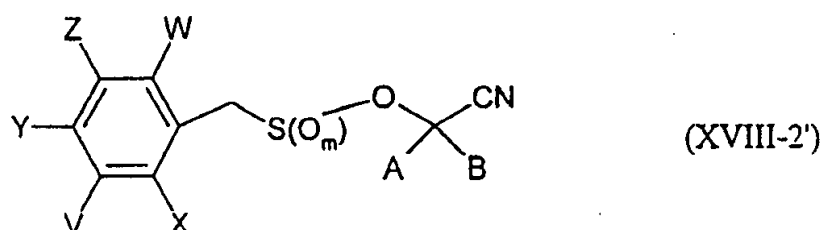
首先将 4.48g 2-羟基异丁腈加至 120ml 的二氯甲烷中, 并与 7.2g 三乙胺混合, 然后在 0℃ 下逐滴加入 10g 4-氟苄基磺酰氯并在室温下

将混合物搅拌 6 小时。将反应溶液溶解在水中并分离有机相,干燥并浓缩。用硅胶色谱纯化剩余物,使用甲苯/醚 10:1 作为流动相。

产率:5.1g(约理论值的 37%),熔点 68℃

类似于实施例 XVIII-2'-1 和/或根据对式 (XVIII-2') 化合物制备方法的一般性描述制备下列式 (XVIII-2') 化合物。

表 8

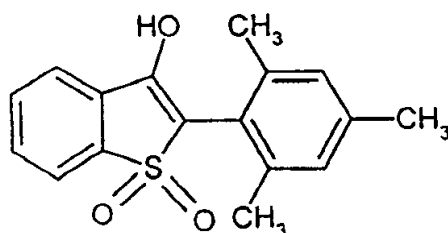


| 实施例号       | V               | W | X | Y                | Z | A               | B               | 熔点 °C |
|------------|-----------------|---|---|------------------|---|-----------------|-----------------|-------|
| XVIII-2'-2 | CF <sub>3</sub> | H | H | H                | H | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 63    |
| XVIII-2'-3 | H               | H | H | OCF <sub>3</sub> | H | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 68    |
| XVIII-2'-4 | NO <sub>2</sub> | H | H | H                | H | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 85    |

其中 m=2

### 实施例 I-3-a-1

10



### 方法 C

15 首先将 0.81g(20.2mmol)的氢化钠(60%)加至 5ml 无水二甲基甲酰胺中,逐滴加入含有 3.2g(9.63mmol)的 2-[[2,4,6-三甲基苯基)-甲基]磺酰基]-苯甲酸甲酯的 5ml 无水二甲基甲酰胺溶液。将混合物在室温下搅拌过夜,然后倾入冰水中并用盐酸酸化,抽吸滤出固体,用冰水和洗涤用溶剂汽油洗涤,然后在空气中干燥。

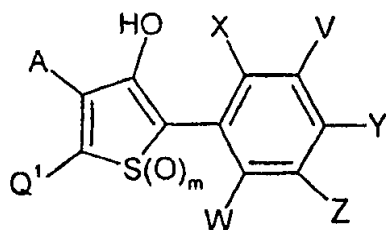
产率:3g(定量)

熔点: 220-225℃

类似于实施例 I-3-a-1 和/或根据对式 (I-3-a) 化合物制备方法的一般性描述制备下列式 (I-3-a) 化合物。

表 9

5

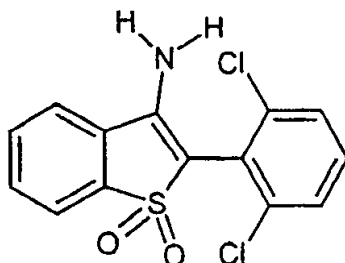


I-3-a

| 实施例号     | V               | W               | X                | Y                      | Z               | A             | Q <sup>1</sup> | m | 熔点 °C   |
|----------|-----------------|-----------------|------------------|------------------------|-----------------|---------------|----------------|---|---------|
| I-3-a-2  | H               | H               | Cl               | -O-CH <sub>2</sub> -O- |                 | -CH=CH-CH=CH- |                | 2 | 210-214 |
| I-3-a-3  | H               | H               | Cl               | Cl                     | H               | -CH=CH-CH=CH- |                | 2 | 152-157 |
| I-3-a-4  | H               | H               | Cl               | CHF <sub>2</sub>       | Cl              | -CH=CH-CH=CH- |                | 2 | 177-182 |
| I-3-a-5  | H               | H               | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>        | CH <sub>3</sub> | -CH=CH-CH=CH- |                | 2 | 179-182 |
| I-3-a-6  | H               | H               | F                | CF <sub>3</sub>        | H               | -CH=CH-CH=CH- |                | 2 | 109-112 |
| I-3-a-7  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>        | H               | -CH=CH-CH=CH- |                | 2 | 143-145 |
| I-3-a-8  | H               | H               | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>        | H               | -CH=CH-CH=CH- |                | 2 | 188     |
| I-3-a-9  | H               | H               | Br               | CH <sub>3</sub>        | Br              | -CH=CH-CH=CH- |                | 2 | 204-208 |
| I-3-a-10 | Br              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>        | H               | -CH=CH-CH=CH- |                | 2 | 160-163 |
| I-3-a-11 | H               | H               | Cl               | Cl                     | Cl              | -CH=CH-CH=CH- |                | 2 | 178     |
| I-3-a-15 | H               | H               | CH <sub>3</sub>  | H                      | CH <sub>3</sub> | -CH=CH-CH=CH- |                | 2 | 178     |
| I-3-a-16 | H               | H               | CH <sub>3</sub>  | OCH <sub>3</sub>       | CH <sub>3</sub> | -CH=CH-CH=CH- |                | 2 | 177     |
| I-3-a-17 | 苯基              | H               | CH <sub>3</sub>  | H                      | H               | -CH=CH-CH=CH- |                | 2 | 204     |
| I-3-a-19 | H               | H               | OCH <sub>3</sub> | Cl                     | Br              | -CH=CH-CH=CH- |                | 2 | 98      |

| 实施例号     | V  | W               | X                | Y               | Z  | A                                                                                     | Q <sup>I</sup> | m | 熔点 °C |
|----------|----|-----------------|------------------|-----------------|----|---------------------------------------------------------------------------------------|----------------|---|-------|
| I-3-a-20 | H  | H               | CF <sub>3</sub>  | Cl              | H  | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | 184   |
| I-3-a-21 | H  | H               | CF <sub>3</sub>  | CF <sub>3</sub> | H  | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | 141   |
| I-3-a-22 | Cl | H               | F                | F               | Cl | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 |       |
| I-3-a-23 | H  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | H  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                                                    |                | 2 | 172   |
| I-3-a-24 | H  | Cl              | Cl               | H               | H  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                                                    |                | 2 | 179   |
| I-3-a-25 | Cl | Cl              | H                | H               | H  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                                                    |                | 2 | 157   |
| I-3-a-26 | H  | H               | Cl               | Cl              | H  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                                                    |                | 2 | 180   |
| I-3-a-27 | H  | H               | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                                                    |                | 2 | 116   |
| I-3-a-29 | H  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | H  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                | 2 | 157   |

### 实施例 I-3-i-1

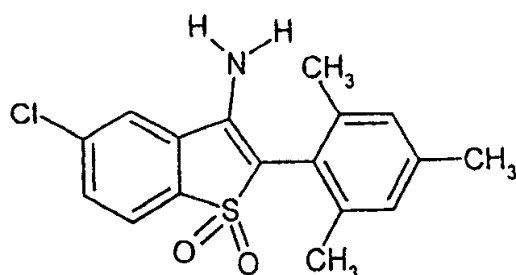


5

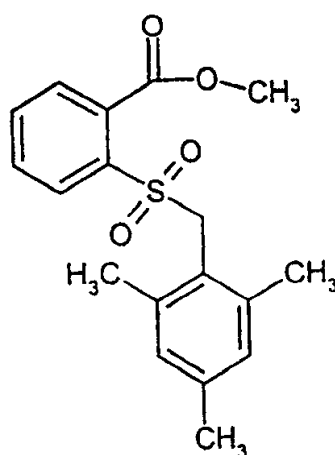
首先将 0.52g 氢化钠 (60%) 加至 8ml 无水二甲基甲酰胺中, 冰浴冷却, 然后逐滴加入已溶解于 8ml 无水二甲基甲酰胺中的 4.2g 实施例 XVIII-3'-1 化合物。将混合物在室温下搅拌过夜, 并将其倾入冰水中, 并用盐酸中和, 然后抽吸滤出固体并干燥。产率: 4.2g (约理论值的 100%), 熔点 242-245°C。

10

类似于实施例 I-3-i-1 制备出实施例 I-3-i-2 化合物, 熔点为 268-270°C。



### 实施例 IV-1

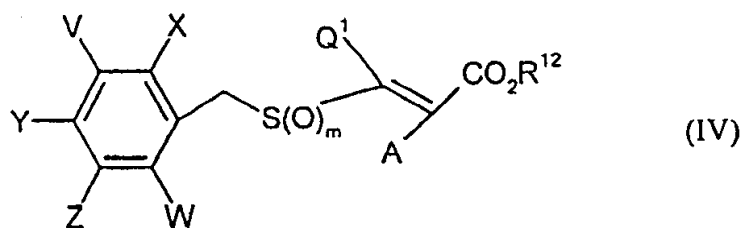


5

首先将 2.9g (9.65mmol) 的 2-[[2-(2,4,6-三甲基苯基)甲基]硫代]苯甲酸甲酯加至 30ml 的  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  中, 分多次每次少量加入 6.66g (19.3mmol) 间氯过苯甲酸 (50%浓度)。将混合物在室温下搅拌过夜并抽吸过滤, 将滤液与 0.5ml 甲硫醚混合并在室温下搅拌 1 小时。与 50ml 饱和  $\text{NaHCO}_3$  溶液混合并在室温下搅拌 30 分钟。分离水相并用  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  抽提两次, 然后将合并的有机相干燥并浓缩。  
 产率: 3.3g (定量), 熔点: 132-136℃。

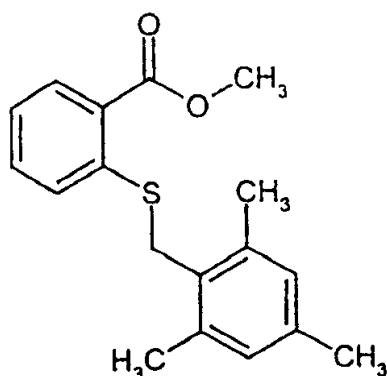
类似于实施例 IV-1 和/或根据对式 (IV) 化合物制备方法的一般性描述制备下列式 (IV) 化合物:

表 10



| 实施<br>例号 | V               | W               | X                | Y                                     | Z               | A                                                                                     | Q <sup>1</sup> | m | R <sup>12</sup> | 熔点 °C   |
|----------|-----------------|-----------------|------------------|---------------------------------------|-----------------|---------------------------------------------------------------------------------------|----------------|---|-----------------|---------|
| IV-2     | H               | H               | Cl               | -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> - |                 | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 148-154 |
| IV-3     | H               | H               | Cl               | Cl                                    | H               | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 69-71   |
| IV-4     | H               | H               | Cl               | CHF <sub>2</sub>                      | Cl              | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 114-119 |
| IV-5     | H               | H               | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                       | CH <sub>3</sub> | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 油       |
| IV-6     | H               | H               | F                | CF <sub>3</sub>                       | H               | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 99-103  |
| IV-7     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                       | H               | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 油       |
| IV-8     | H               | H               | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                       | H               | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 油       |
| IV-9     | H               | H               | Br               | CH <sub>3</sub>                       | Br              | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 160-163 |
| IV-10    | Br              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                       | H               | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 137-138 |
| IV-11    | H               | H               | Cl               | Cl                                    | Cl              | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 160-165 |
| IV-15    | H               | H               | CH <sub>3</sub>  | H                                     | CH <sub>3</sub> | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 164-168 |
| IV-16    | H               | H               | CH <sub>3</sub>  | OCH <sub>3</sub>                      | CH <sub>3</sub> | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 154-157 |
| IV-17    | 苯基              | H               | CH <sub>3</sub>  | H                                     | H               | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 113-115 |
| IV-19    | H               | H               | F                | Cl                                    | Br              | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 136-139 |
| IV-20    | H               | H               | CF <sub>3</sub>  | Cl                                    | H               | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 119-123 |
| IV-21    | H               | H               | CF <sub>3</sub>  | CF <sub>3</sub>                       | H               | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 94      |
| IV-22    | Cl              | H               | F                | F                                     | Cl              | -CH=CH-CH=CH-                                                                         |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 168-170 |
| IV-23    | H               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                       | H               | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                                                    |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 145     |
| IV-24    | H               | Cl              | Cl               | H                                     | H               | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                                                    |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 油       |
| IV-25    | Cl              | Cl              | H                | H                                     | H               | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                                                    |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 油       |
| IV-26    | H               | H               | Cl               | Cl                                    | H               | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                                                    |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 油       |
| IV-27    | H               | H               | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                       | Cl              | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                                                    |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 油       |
| IV-29    | H               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                       | H               | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                | 2 | CH <sub>3</sub> | 165     |

# 实施例 XXXI-1



将 0.864g(16mmol)的甲醇钠溶解在 15ml 的无水甲醇中,加入  
 5 2.52g(15mmol)的硫代水杨酸甲酯,然后缓慢逐滴加入 2.53g(15mmol)  
 的 2,4,6-三甲基苄基氯。将混合物在室温下搅拌过夜,浓缩并与水混  
 合,然后将结晶抽吸滤出,用洗涤用溶剂汽油洗涤并在空气中干燥。

产率:2.98g(理论值的 66.1%),熔点:115-118℃

类似于实施例 XXXI-1 和/或根据对式 (XXXI) 化合物制备方法的  
 10 一般性描述制备下列式 (XXXI) 化合物:

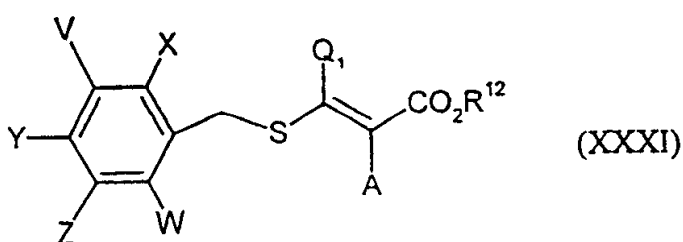
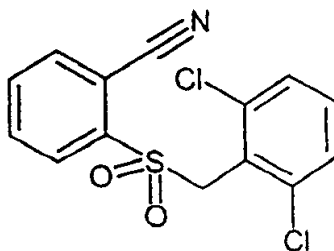


表 11

| 实施例号   | V | W | X  | Y                      | Z | A             | Q <sup>I</sup> | R <sup>12</sup> | 熔点 °C   |
|--------|---|---|----|------------------------|---|---------------|----------------|-----------------|---------|
| XXXI-2 | H | H | Cl | -O-CH <sub>2</sub> -O- |   | -CH=CH-CH=CH- |                | CH <sub>3</sub> | 120-123 |
| XXXI-3 | H | H | Cl | Cl                     | H | -CH=CH-CH=CH- |                | CH <sub>3</sub> | 111-115 |

| 实施例号    | V               | W               | X               | Y                | Z               | A             | Q <sup>1</sup>  | R <sup>12</sup> | 熔点 °C   |
|---------|-----------------|-----------------|-----------------|------------------|-----------------|---------------|-----------------|-----------------|---------|
| XXXI-4  | H               | H               | Cl              | CHF <sub>2</sub> | Cl              | -CH=CH-CH=CH- | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 126-129 |
| XXXI-5  | H               | H               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | -CH=CH-CH=CH- | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 104-106 |
| XXXI-6  | H               | H               | F               | CF <sub>3</sub>  | H               | -CH=CH-CH=CH- | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 112-115 |
| XXXI-7  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | H               | -CH=CH-CH=CH- | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 131-134 |
| XXXI-8  | H               | H               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | H               | -CH=CH-CH=CH- | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 79      |
| XXXI-9  | H               | H               | Br              | CH <sub>3</sub>  | Br              | -CH=CH-CH=CH- | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 143     |
| XXXI-10 | Br              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | H               | -CH=CH-CH=CH- | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 125     |
| XXXI-11 | H               | H               | F               | Cl               | Br              | -CH=CH-CH=CH- | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 106     |
| XXXI-12 | H               | H               | CF <sub>3</sub> | Cl               | H               | -CH=CH-CH=CH- | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 82-83   |
| XXXI-13 | H               | H               | CF <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub>  | H               | -CH=CH-CH=CH- | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 108-111 |
| XXXI-14 | Cl              | H               | F               | F                | Cl              | -CH=CH-CH=CH- | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 132-135 |
| XXXI-15 | H               | H               | Cl              | Cl               | Cl              | -CH=CH-CH=CH- | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 148     |
| XXXI-19 | H               | H               | CH <sub>3</sub> | H                | CH <sub>3</sub> | -CH=CH-CH=CH- | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 135-139 |
| XXXI-20 | H               | H               | CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | -CH=CH-CH=CH- | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 143-146 |
| XXXI-21 | Phenyl          | H               | CH <sub>3</sub> | H                | H               | -CH=CH-CH=CH- | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 91      |

### 实施例 XVIII-3'-1



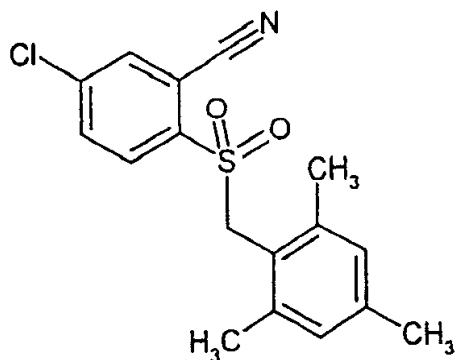
5

首先将 4.7g 实施例 XXXVI-1 化合物加至 90ml 二氯甲烷中, 然后在室温下加入 11.03g 间氯过苯甲酸。将混合物搅拌过夜, 抽吸滤出沉淀并将滤液与 0.5ml 甲硫醚混合, 然后搅拌 1 小时。加入 50ml 饱和碳酸氢钠溶液, 然后将混合物用二氯甲烷抽提两次, 并干燥抽提物和浓缩。剩余物用异丙醇搅拌并抽吸滤出结晶。

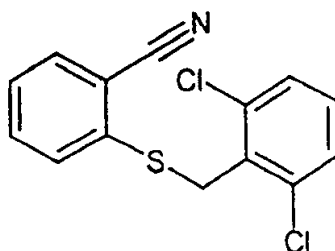
10

产率: 4.9g (约理论值的 94%), 熔点为 187-189℃。

类似实施例 XVIII-3'-1 制备获得实施例 XVIII-3'-2 化合物, 熔点为 190-193℃。



### 实施例 XXXVI-1

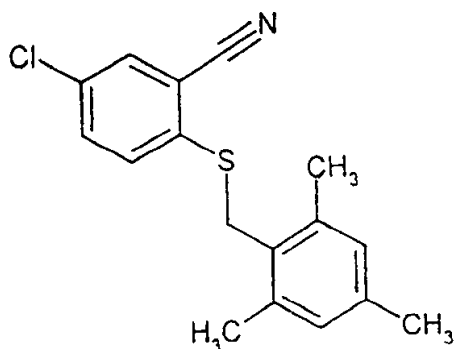


5

首先将 0.8g 氢化钠 (60%) 加至 10ml 无水二甲基甲酰胺 (DMF) 中, 在 0℃ 下, 逐滴加入 3.86g 2,6-二氯苄基硫醇的 10ml 无水 DMF 溶液。30 分钟后, 在 0℃ 下逐滴加入 2.42g 2-氯苄腈, 将混合物在室温下搅拌过夜, 然后将其倾入水中并抽吸滤出, 沉淀用异丙醇搅拌, 再次抽吸  
10 滤出并干燥。

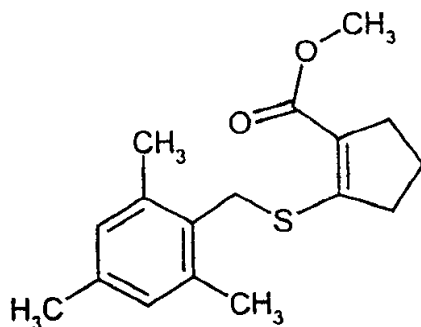
产率: 4.89g (约理论值的 83%), 熔点为 111℃。

类似实施例 XXXVI-1 的方法制备获得实施例 XXXVI-2, 熔点为 146℃。



15

# 实施例 XXXI-23



将 1.42g (10mmol) 的环戊酮羧酸甲酯, 2g (12mmol) 的 2,4,6-三甲  
 5 基苄基硫醇和 1.9g (10mmol) 的对甲苯磺酸水合物的 20ml 乙酸混合物  
 在室温下搅拌过夜。将混合物倾入水中并抽吸滤出固体, 用水和洗涤  
 用溶剂汽油洗涤并在空气中干燥。

产率: 0.914g (理论值的 31.5%), 熔点为 139℃。

类似于实施例 XXXI-23 和/或根据对式 (XXXI) 化合物制备方法  
 10 (变换方法 2) 的一般性描述制备下列式 (XXXI) 化合物:

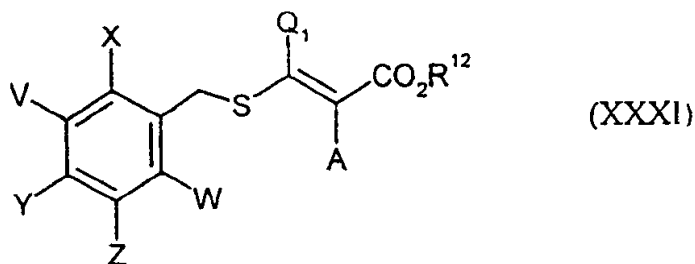


表 12

| 实施例号    | V  | W  | X  | Y  | Z | A                                  | Q <sup>1</sup> | R <sup>12</sup> | 熔点 °C |
|---------|----|----|----|----|---|------------------------------------|----------------|-----------------|-------|
| XXXI-24 | H  | Cl | Cl | H  | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> - |                | CH <sub>3</sub> | 152   |
| XXXI-25 | Cl | Cl | H  | H  | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> - |                | CH <sub>3</sub> | 油     |
| XXXI-26 | H  | H  | Cl | Cl | H | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> - |                | CH <sub>3</sub> | 129   |

| 实施例号    | V | W               | X                | Y               | Z  | A                                                                                     | Q <sup>1</sup> | R <sup>12</sup>               | 熔点 °C |
|---------|---|-----------------|------------------|-----------------|----|---------------------------------------------------------------------------------------|----------------|-------------------------------|-------|
| XXXI-27 | H | H               | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                                                    |                | CH <sub>3</sub>               | 油     |
| XXXI-29 | H | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | H  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -                                                    |                | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 油     |
| XXXI-30 | H | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | H  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                | CH <sub>3</sub>               | 87    |

## 应用实施例

### 实施例 A

#### 5 黑尾叶蝉试验

溶剂: 7 重量份的 二甲基甲酰胺

乳化剂: 1 重量份的 烷芳基聚乙二醇醚

为制备适合的活性化合物制剂, 将 1 重量份活性化合物与上述量的溶剂和乳化剂混合, 并用含有乳化剂的水稀释浓缩物至所需浓度。

10 将稻秧苗 (*Oryza sativa*) 浸在所需浓度的活性化合物制剂中进行处理并在秧苗上定殖黑尾叶蝉同时保持叶片湿润。

在一段确定的时间后, 测定杀虫活性%。100%意为所有叶蝉被杀死; 0%意为没有叶蝉被杀死。

15 在此试验中, 例如制备实施例 I-1-a-1 和 I-1-a-11 化合物在使用 6 天后, 使用 0.1% 的活性化合物浓度的情况下, 死亡率为 100%。

### 实施例 B

#### 菜蛾试验

溶剂: 7 重量份的 二甲基甲酰胺

20 乳化剂: 1 重量份的 烷芳基聚乙二醇醚

为制备适合的活性化合物制剂, 将 1 重量份活性化合物与上述量的溶剂和乳化剂混合, 并用含有乳化剂的水稀释浓缩物至所需浓度。

将卷心菜 (*Brassica oleracea*) 叶浸在所需浓度的活性化合物制剂中进行处理并在菜上定殖菜蛾幼虫同时保持叶片湿润。

25 在一段确定的时间后, 测定杀虫活性%。100%意为所有幼虫被杀死; 0%意为没有幼虫被杀死。

在此试验中, 例如制备实施例 I-1-i-5 化合物在使用 7 天后, 使用 0.1% 的活性化合物浓度的情况下, 死亡率为 100%。

### 实施例 C

#### 菜蛾试验/合成饲料

溶剂: 100 重量份的 丙酮

乳化剂: 1900 重量份的 甲醇

- 5 为制备适合的活性化合物制剂, 将 1 重量份活性化合物与上述量的溶剂混合, 并用甲醇稀释浓缩物至所需浓度。

将上述量的所需浓度活性化合物制剂用吸移管吸至标准量的合成饲料上。待甲醇蒸发后, 将有约 100 头小菜蛾卵覆盖的薄膜盒盖放至每个小室内。将刚孵化的幼虫移至处理后的合成饲料上。

- 10 在此试验中, 例如制备实施例 I-2-i-3 化合物在使用 7 天后, 使用 0.1% 的活性化合物浓度的情况下, 表现出效果为 95%。