

[19] 中华人民共和国国家知识产权局



[12] 发明专利说明书

专利号 ZL 02827393.1

[51] Int. Cl.

C07D 513/04 (2006.01)

C07D 307/60 (2006.01)

C07D 493/10 (2006.01)

C07D 495/10 (2006.01)

C07D 207/42 (2006.01)

C07D 277/34 (2006.01)

[45] 授权公告日 2006 年 11 月 22 日

[11] 授权公告号 CN 1285597C

[51] Int. Cl. (续)

A01N 43/08 (2006.01)

A01N 43/10 (2006.01)

A01N 43/36 (2006.01)

[22] 申请日 2002.11.18 [21] 申请号 02827393.1

[30] 优先权

[32] 2001.11.29 [33] DE [31] 10158560.8

[86] 国际申请 PCT/EP2002/012881 2002.11.18

[87] 国际公布 WO2003/045957 德 2003.6.5

[85] 进入国家阶段日期 2004.7.21

[71] 专利权人 拜尔农作物科学股份公司

地址 德国蒙海姆

[72] 发明人 R·费希尔 A·乌尔曼恩

T·布雷特施奈德

M·W·德雷维斯 C·埃德伦

D·福伊希特 U·雷克曼恩

K·-H·库克

U·瓦臣多夫-纽曼恩

审查员 刘广南

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 李连涛 徐雁漪

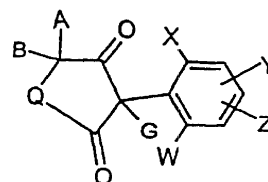
权利要求书 7 页 说明书 76 页

[54] 发明名称

3-联苯取代的-3-取代的-4-酮内酰胺和
酮-内酯及其作为杀虫剂的应用

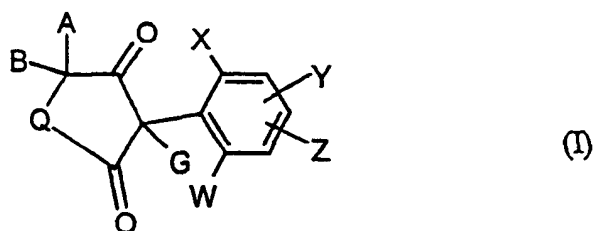
[57] 摘要

本发明涉及新的 3-联苯取代的-3-取代的-4-酮内酰胺和-酮内酯、其制备方法和其作为杀虫剂和/或杀微生物剂和/或除草剂的用途，其中 A、B、Q、G、W、X、Y 和 Z 具有上述含义。



(I)

1. 式(I)化合物,

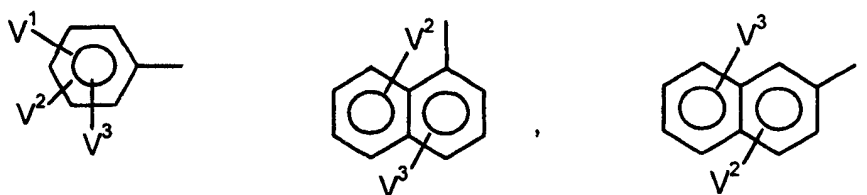


其中

Q 表示氧、硫或基团 N-D,

W 表示氢、卤素、C₁-C₆-烷基或 C₁-C₆-烷氧基,

X 表示卤素、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基或氰基, Y 表示下述基团之一



V¹ 表示氢、卤素、C₁-C₁₂-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷基硫基、C₁-C₆-烷基亚硫酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-卤代烷氧基、硝基或氰基,

V² 和 V³ 相互独立表示氢、卤素、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基或 C₁-C₄-卤代烷氧基,

Z 表示氢、卤素、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、硝基或氰基,

A 表示各自任选被卤素取代的 C₁-C₁₂-烷基、C₃-C₈-烯基、C₁-C₁₀-烷氧基-C₁-C₈-烷基、多-C₁-C₈-烷氧基-C₁-C₈-烷基、C₁-C₁₀-烷基硫基-C₁-C₆-烷基、任选被卤素、C₁-C₆-烷基或 C₁-C₆-烷氧基取代的 C₃-C₈-环烷基, 其中任选一或两个不直接相邻的环单元被氧和/或硫替代,

B 表示氢、C₁-C₁₂-烷基或 C₁-C₈-烷氧基-C₁-C₆-烷基, 或

A、B 和与它们相连的碳原子一起表示饱和的 C_3-C_{10} -环烷基或不饱和的 C_5-C_{10} -环烷基，其中任选一个环单元被氧或硫替代并且其任选一或两次被 C_1-C_8 -烷基、 C_3-C_{10} -环烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_8 -烷氧基、 C_1-C_8 -烷基硫基、卤素或苯基取代，或

A、B 和与它们相连的碳原子一起表示 C_3-C_6 -环烷基，其被任选含有一或两个不直接相邻的氧和/或硫原子的烷二基、或被亚烷基二氧基或被亚烷基二硫基取代，该基团与和它相连的碳原子形成另一个五至八元环，

D 表示氢、各自任选被卤素取代的 C_1-C_{12} -烷基、 C_3-C_8 -烯基、 C_3-C_8 -炔基、 C_1-C_{10} -烷氧基- C_2-C_8 -烷基、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_2-C_8 -烷基、 C_1-C_{10} -烷基硫基- C_2-C_8 -烷基，

G 表示卤素或硝基。

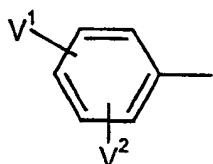
2. 权利要求 1 的式 (I) 化合物，其中

Q 表示氧、硫或基团 N-D，

W 表示氢、氟、氯、溴或 C_1-C_4 -烷基，

X 表示氟、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 -卤代烷氧基或氰基，

Y 表示基团



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

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

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

A 表示各自任选一至五次被氟或氯取代的 C_1-C_{10} -烷基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基、任选一至两次被氟、氯、 C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_4 -烷氧基取

代的 C_3-C_7 -环烷基, 其中任选一个环单元被氧或硫替代,

B 表示氢或 C_1-C_6 -烷基, 或者

A、B 和与它们相连的碳原子一起表示饱和的 C_3-C_8 -环烷基, 其中任选一个环单元被氧或硫替代和其任选一至两次被 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_3 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、氟、氯或苯基取代, 条件是, 在基团 (I-1) 中 D 表示氢或 C_1-C_4 -烷基,

D 表示氢, 表示各自任选一至五次被氟或氯取代的 C_1-C_{10} -烷基、 C_3-C_6 -烯基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_2-C_4 -烷基或 C_1-C_4 -烷基硫基- C_2-C_4 -烷基,

G 表示氯、溴或硝基。

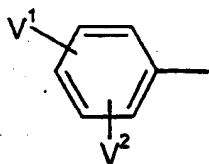
3. 权利要求 1 的式 (I) 化合物, 其中

Q 表示氧、硫或基团 N-D,

W 表示氢、氟、氯、甲基或乙基,

X 表示氟、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、三氟甲氧基或氰基,

Y 表示基团



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

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

Z 表示氢、氟、氯、甲基、乙基、正丙基或甲氧基,

A 表示 C_1-C_6 -烷基或 C_1-C_2 -烷氧基- C_1-C_2 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基, 其中任选一个环单元被氧或硫替代,

B 表示氢、甲基或乙基, 或

A、B 和与它们相连的碳原子一起表示饱和的 C_3-C_8 -环烷基, 其中任选一个环单元被氧或硫替代和其任选被甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、

异丙氧基、正丁氧基或异丁氧基单取代，条件是，D 在基团 (I-1) 中表示氢或 C_1-C_3 -烷基，

D 表示氢、甲基、乙基、正丙基或异丙基，

A、D 一起表示任选被取代的 C_3-C_4 -烷二基，其中任选一个碳原子被氧或硫替代，

G 表示氯或硝基。

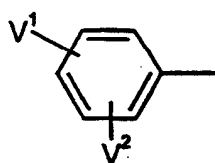
4. 权利要求 1 的式 (I) 化合物，其中

Q 表示基团 N-D，

W 表示氢、氯或甲基，

X 表示氯、甲基或乙基，

Y 表示基团



V¹ 表示氯或甲基，

V² 表示氢或氯，

Z 表示氢或甲基，

A 表示甲基、乙基、丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、环丙基、环戊基或环己基，

B 表示甲基，

A、B 和与它们相连的碳原子一起表示饱和的 C_3-C_8 -环烷基，其中任选一个环单元被氧或硫替代和其任选被甲基或在 C_6 -环烷基的情况下也被乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基或异丁氧基单取代，

D 表示氢，

G 表示氯或硝基。

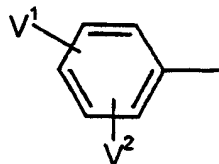
5. 权利要求 1 的式 (I) 化合物，其中

Q 表示氧，

W 表示氢、氯或甲基，

X 表示氯、甲基或乙基,

Y 表示基团



V^1 表示氯、氟、氰基或甲基,

V^2 表示氢或氯,

Z 表示氢或甲基,

A 表示甲基、乙基、丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、环丙基、环戊基或环己基,

B 表示甲基, 或

A、B 和与它们相连的碳原子一起表示饱和的 C_3-C_8 -环烷基, 其中任选一个环单元被氧或硫替代并且其任选被甲基或在 C_6 -环烷基的情况下也被乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基或异丁氧基单取代,

G 表示氯。

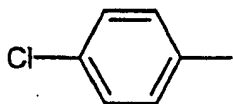
6. 权利要求 1 的式(I)化合物, 其中

Q 表示硫,

W 表示氢,

X 表示氯或甲基,

Y 表示基团



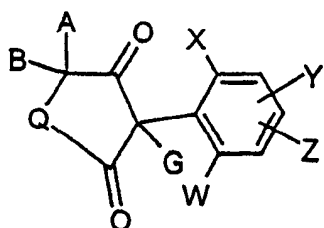
Z 表示氢或甲基,

A、B 和与它们相连的碳原子一起表示饱和的 C_5-C_6 -环烷基, 其中任选一个环单元被氧替代并且其任选被甲基或甲氧基取代,

G 表示氯。

7. 制备按照权利要求 1 的式 (I) 化合物的方法, 其特征在于

A) 式 (I-1) 至 (I-3) 的化合物



(I-1) 至 (I-3)

其中

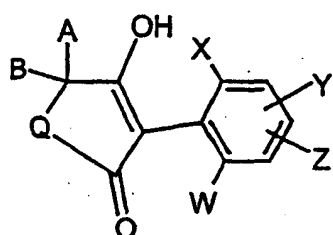
A、B、Q、W、X、Y 和 Z 具有上述含义

和

G 表示卤素,

可通过

式 (II-1) 至 (II-3) 的化合物

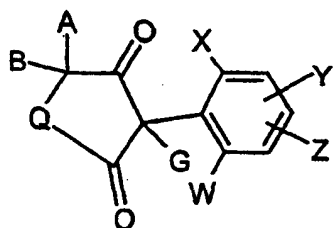


(II-1) 至 (II-3)

其中 A、B、Q、W、X、Y 和 Z 具有上述含义

与卤化剂在溶剂存在下和任选在自由基引发剂存在下反应得到, 或

B) 式 (I-1) 至 (I-3) 化合物



(I-1) 至 (I-3)

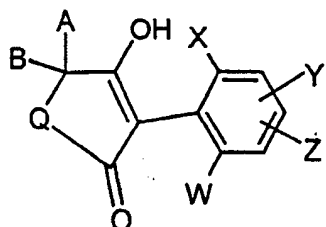
其中 A、B、Q、W、X、Y 和 Z 具有上述含义

和

G 表示硝基,

可通过

式 (II-1) 至 (II-3) 化合物



(II-1) 至 (II-3)

其中

A、B、Q、W、X、Y 和 Z 具有上述含义

与硝化试剂在溶剂存在下反应得到。

8. 杀虫剂或除草剂或杀真菌剂，其特征在于含有至少一种权利要求 1 的式 (I) 化合物。

9. 防治害虫或不希望的植物或真菌的方法，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。

10. 权利要求 1 的式 (I) 化合物用于防治害虫或不希望的植物或真菌的用途。

11. 杀虫剂或除草剂或杀真菌剂的制备方法，其特征在于将权利要求 1 的式 (I) 化合物与增量剂和/或表面活性剂混合。

12. 按照权利要求 1 的式 (I) 化合物用于制备杀虫剂或除草剂或杀真菌剂的用途。

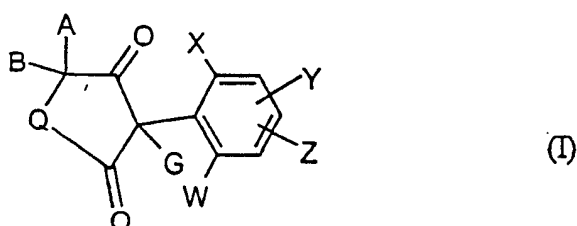
3-联苯取代的-3-取代的-4-酮内酰胺 和酮-内酯及其作为杀虫剂的应用

本发明涉及新的 3-联苯取代的-3-取代的-4-酮内酰胺和-内酯、其制备方法和用于其制备的中间体以及其作为害虫防治剂、杀微生物剂和/或除草剂的用途。

已知，一些苯基取代的 3-卤代-4-酮内酰胺 (JP-A-10-258 555) 和苯基取代的 3-卤代-4-酮内酯 (JP-A-10-258 555) 具有杀螨剂、杀虫剂和/或除草剂活性。

但是这些化合物活性和作用范围，特别是在低用量和浓度下却不总能完全令人满意。此外，这些化合物在农作物中的植物耐受性有时不足。

现已发现新的式 (I) 化合物，



其中

Q 表示氧、硫或基团 N-D，

X 表示卤素、烷基、烷氧基、烯基氧基、烷基硫基、烷基亚硫酰基、烷基磺酰基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代烯基氧基、硝基、氰基或任选被取代的苯基，

Y 表示各自任选被取代的芳基或杂芳基，

W 和 Z 相互独立表示氢、卤素、烷基、烷氧基、卤代烷基、卤代烷氧基、硝基或氰基，

A 表示氢、各自任选被取代的烷基、烯基、烷氧基烷基、多烷氧基烷基、烷基硫基烷基、饱和的或不饱和的、任选被取代的环烷基，其中任选至少一个环原子被杂原子替代，或各自任选被卤素、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基、氰基或硝基取代的芳基、芳基烷基或

杂芳基,

B 表示氢、烷基或烷氧基烷基, 或

A 和 B 与和它们连接的碳原子一起表示饱和的或不饱和的、任选含有至少一个杂原子的未被取代的或被取代的环,

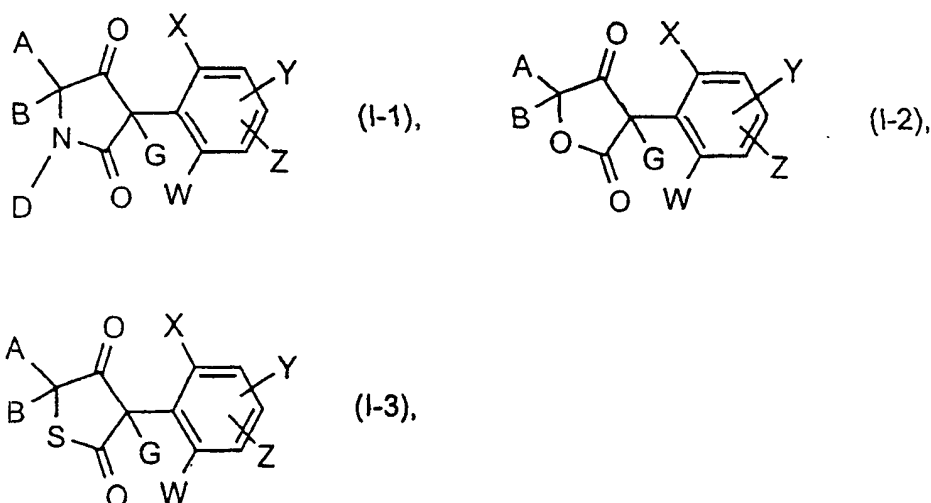
D 表示氢或任选被取代的基团, 选自烷基、烯基、炔基、烷氧基烷基、多烷氧基烷基、烷基硫基烷基、饱和的或不饱和的环烷基, 其中任选一个或多个环单元被杂原子替代、芳基烷基、芳基、杂芳基烷基或杂芳基, 或

A 和 D 与和它们连接的原子一起表示饱和的或不饱和的和任选含有至少一个杂原子的、在 A, D-部分未被取代的或被取代的环,

G 表示卤素或硝基。

式(I)化合物, 也取决于取代基的种类, 可以几何和/或光学异构体或者以不同组成的异构体混合物形式存在, 所述异构体混合物可任选通过常规方法分离。这些纯的异构体和异构体混合物、其制备和应用以及包含它们的组合物都是本发明的主题。下面为了简便起见总是提及式(I)化合物, 但是这既指纯的化合物也任选指具有不同异构体化合物含量的异构体混合物。

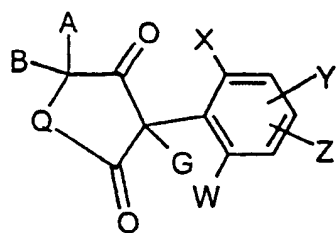
包括基团 Q 的所有含义得到下述主要结构 (I-1) 至 (I-3):



其中

A、B、D、G、W、X、Y 和 Z 具有上述含义。

A) 此外, 已发现, 式 (I-1) 至 (I-3) 的化合物



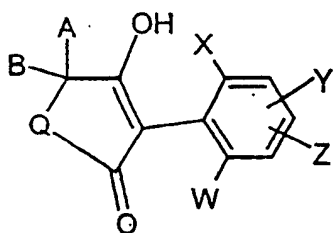
(I-1) 至 (I-3)

其中 A、B、Q、W、X、Y 和 Z 具有上述含义
和

G 表示卤素, 优选表示氯和溴,

可通过如下得到:

式 (II-1) 至 (II-3) 的化合物

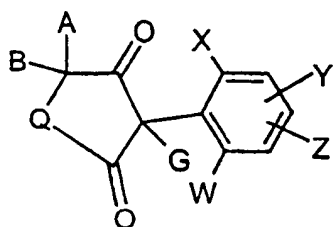


(II-1) 至 (II-3)

其中 A、B、Q、W、X、Y 和 Z 具有上述含义

与卤化剂在溶剂存在下和任选存在自由基引发剂存在下反应。

B) 此外, 式 (I-1) 至 (I-3) 化合物



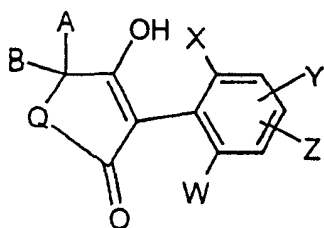
(I-1) 至 (I-3)

其中 A、B、Q、W、X、Y 和 Z 具有上述含义
和

G 表示硝基,

可通过如下得到:

式(II-1)至(II-3)的化合物



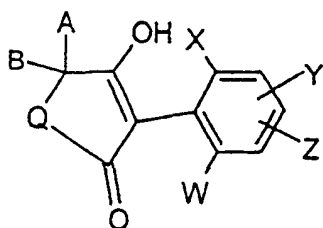
(II-1) 至 (II-3)

其中

A、B、Q、W、X、Y 和 Z 具有上述含义

与硝化试剂，如发烟硝酸在溶剂存在下反应。

在方法 A 和 B 中需要的式(II-1)至(II-3)化合物



(II-1) 至 (II-3)

其中

A、B、Q、W、X、Y 和 Z 具有上述含义，

是已知化合物(WO 99/43649、WO 99/48869、WO 99/55673)或可通过其中描述的方法合成。

用于方法 A 的卤化剂包括例如磺酰氯、磺酰溴、亚磺酰氯、亚磺酰溴、酰亚胺如 N-溴琥珀酰亚胺或 N-氯琥珀酰亚胺、氯磺酸以及次氯酸酯，例如叔丁基次氯酸酯。

用于方法 B 的硝化试剂包括发烟硝酸以及硝化酸混合物。

此外，已发现式(I)新的化合物作为害虫防治剂，优选作为杀虫剂、杀螨剂和/或杀真菌剂和/或除草剂具有很好的活性。

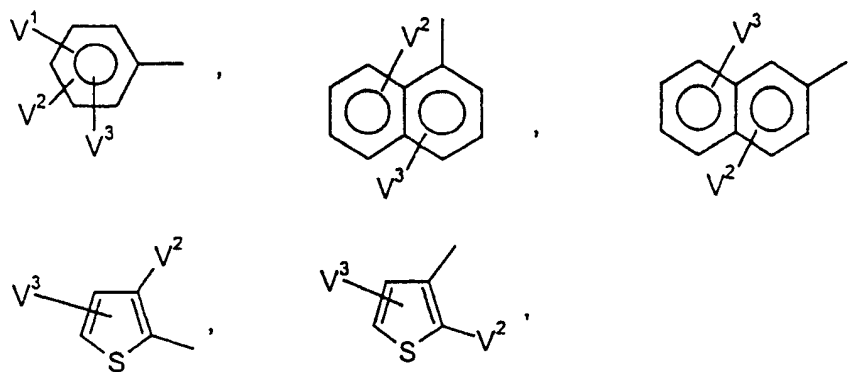
本发明化合物通过式(I)进行一般定义。列于上述和下述结构式中的基团的优选的取代基或范围在下述详细说明：

Q 优选表示氧、硫或基团 N-D，

W 优选表示氢、卤素、C₁-C₆-烷基或 C₁-C₆-烷氧基，

X 优选表示卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、氰基或任选被卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、硝基或氰基取代的苯基，

Y 优选表示下述基团之一



V^1 优选表示氢、卤素、 C_1-C_{12} -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷基硫基、 C_1-C_6 -烷基亚硫酰基、 C_1-C_6 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、硝基、氰基或任选一至两次被卤素、 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，

V^2 和 V^3 优选相互独立表示氢、卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基或 C_1-C_4 -卤代烷氧基，

Z 优选表示氢、卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、硝基或氰基，

A 优选表示各自任选被卤素取代的 C_1-C_{12} -烷基、 C_3-C_8 -烯基、 C_1-C_{10} -烷氧基- C_1-C_8 -烷基、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基、 C_1-C_{10} -烷基硫基- C_1-C_6 -烷基、任选被卤素、 C_1-C_6 -烷基或 C_1-C_6 -烷氧基取代的 C_3-C_8 -环烷基，其中任选一或两个不直接相邻的环单元被氧和/或硫替代或表示各自任选被卤素、 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 -烷基或在基团 (I-1) 的情况下如果 D 不表示氢时，表示氢，

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

A、B 和与它们相连的碳原子一起优选表示饱和的 C_3-C_{10} -环烷基或不饱和的 C_5-C_{10} -环烷基，其中任选一个环单元被氧或硫替代并且其任选

一或两次被 C_1-C_8 -烷基、 C_3-C_{10} -环烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_8 -烷氧基、 C_1-C_8 -烷基硫基、卤素或苯基取代，或

A、B 和与它们相连的碳原子一起优选表示 C_3-C_6 -环烷基，其被任选含有一或两个不直接相邻的氧和/或硫原子的烷二基、或被亚烷基二氧基或被亚烷基二硫基取代，该基团与和它相连的碳原子形成另一个五至八元环，或

A、B 和与它们相连的碳原子一起优选表示 C_3-C_8 -环烷基或 C_5-C_8 -环烯基，其中两个取代基与和它们连接的碳原子一起表示各自任选被 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 -二烯二基，其中任选一个亚甲基被氧或硫替代。

D 优选表示氢、各自任选被卤素取代的 C_1-C_{12} -烷基、 C_3-C_8 -烯基、 C_3-C_8 -炔基、 C_1-C_{10} -烷氧基- C_2-C_8 -烷基、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_2-C_8 -烷基、 C_1-C_{10} -烷基硫基- C_2-C_8 -烷基、任选被卤素、 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，其中任选一个环单元被氧或硫替代或任选被卤素、 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，

A 和 D 一起优选表示各自任选被取代的 C_3-C_6 -烷二基或 C_3-C_6 -烯二基，其中任选一个亚甲基被氧或硫替代，和
其中的取代基在各种情况下可以是： C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基或另一个 C_3-C_6 -烷二基，

G 优选表示氯、溴或硝基。

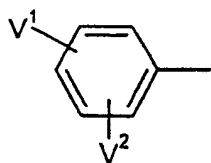
在作为优选提到的基团定义中，卤素表示氟、氯、溴和碘，特别是表示氟、氯和溴。

Q 特别优选表示氧、硫或基团 N-D，

W 特别优选表示氢、氯、溴或 C_1-C_4 -烷基，

X 特别优选表示氟、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 -卤代烷氧基或氰基，

Y 特别优选表示基团



V¹ 特别优选表示氢、氟、氯、溴、C₁-C₆-烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₂-卤代烷基、C₁-C₂-卤代烷氧基、硝基或氰基、任选一或两次被氟、氯、溴、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₂-卤代烷基、C₁-C₂-卤代烷氧基、硝基或氰基取代的苯基，

V² 特别优选表示氢、氟、氯、溴、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₂-卤代烷基或 C₁-C₂-卤代烷氧基，

Z 特别优选表示氢、氟、氯、溴、C₁-C₄-烷基、C₁-C₂-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或 C₁-C₂-卤代烷氧基，

A 特别优选表示各自任选一至五次被氟或氯取代的 C₁-C₁₀-烷基、C₁-C₈-烷氧基-C₁-C₆-烷基、任选一至两次被氟、氯、C₁-C₄-烷基或 C₁-C₄-烷氧基取代的 C₃-C₇-环烷基，其中任选一个环单元被氧或硫替代或各自任选一至两次被氟、氯、溴、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或 C₁-C₄-卤代烷氧基取代的苯基或苯基-C₁-C₄-烷基或在基团 (I-1) 的情况下如果 D 不表示氢时，表示氢，

B 特别优选表示氢或 C₁-C₆-烷基，或者

A、B 和与它们相连的碳原子一起特别优选表示饱和的 C₃-C₈-环烷基，其中任选一个环单元被氧或硫替代和其任选一至两次被 C₁-C₆-烷基、C₅-C₆-环烷基、C₁-C₃-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、氟、氯或苯基取代，条件是，在基团 (I-1) 中 D 表示氢或 C₁-C₄-烷基，

D 特别优选表示氢，表示各自任选一至五次被氟或氯取代的 C₁-C₁₀-烷基、C₃-C₆-烯基、C₁-C₄-烷氧基-C₂-C₄-烷基或 C₁-C₄-烷基硫基-C₂-C₄-烷基，表示任选一至两次被氟、氯、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基或 C₁-C₂-卤代烷基取代的 C₃-C₇-环烷基，其中任选一个亚甲基被氧或硫替代或表示任选一至两次被氟、氯、溴、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或 C₁-C₄-卤代烷氧基取代的苯基，或

A 和 D 一起特别优选表示任选取代的 C₃-C₅-烷二基，其中一个亚甲基可被氧或硫替代，其中的取代基可以是 C₁-C₄-烷基，

G 特别优选表示氯、溴或硝基。

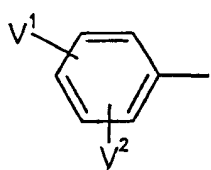
在作为特别优选提到的基团定义中，卤素表示氟、氯、溴和碘，特别是表示氟、氯和溴。

Q 十分特别优选表示氧、硫或基团 N-D，

W 十分特别优选表示氢、氟、氯、甲基或乙基，

X 十分特别优选表示氟、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、三氟甲氧基或氰基，

Y 十分特别优选表示基团



V¹ 十分特别优选表示氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、硝基或氰基，

V² 十分特别优选表示氢、氟、氯、甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、三氟甲基或三氟甲氧基，

Z 十分特别优选表示氢、氟、氯、甲基、乙基、正丙基或甲氧基，

A 十分特别优选表示 C₁-C₆-烷基或 C₁-C₂-烷氧基-C₁-C₂-烷基、C₃-C₆-环烷基，其中任选一个环单元被氧或硫替代或在基团 (I-1) 的情况下如果 D 不表示氢时，表示氢，

B 十分特别优选表示氢、甲基、乙基，或

A、B 和与它们相连的碳原子一起十分特别优选表示饱和的 C₃-C₈-环烷基，其中任选一个环单元被氧或硫替代和其任选被甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基或异丁氧基单取代，条件是，D 在基团 (I-1) 中表示氢或 C₁-C₃-烷基，特别是表示氢，

D 十分特别优选表示氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、环丙基、环戊基或环己基，特别优选表示氢，

A、D 一起十分特别优选表示任选被取代的 C₃-C₄-烷二基，其中任选一

个碳原子被氧或硫替代,

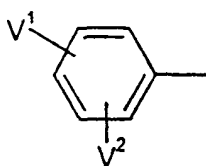
G 十分特别优选表示氯和硝基, 特别是优选表示氯。

尤其优选这样的式 (I-1) 化合物, 其中

W 尤其优选表示氢、氯或甲基,

X 尤其优选表示氯、甲基或乙基,

Y 尤其优选表示基团



V¹ 尤其优选表示氯或甲基,

V² 尤其优选表示氢或氯,

Z 尤其优选表示氢或甲基,

A 尤其优选表示甲基、乙基、丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、环丙基、环戊基或环己基(特别强调的是表示甲基或异丙基),

B 尤其优选表示甲基,

A、B 和与它们相连的碳原子一起尤其优选表示饱和的 C₃-C₈-环烷基, 其中任选一个环单元被氧或硫替代和其任选被甲基或在 C₆-环烷基的情况下也被乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基或异丁氧基单取代(特别强调的是 C₃-、C₅-或 C₆-环烷基, 其中在 C₆-环烷基的情况下任选一个环原子被氧替代并且其任选被甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基或乙氧基单取代),

D 尤其优选表示氢,

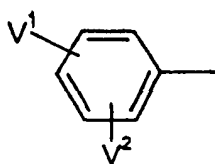
G 尤其优选表示氯或硝基(特别强调的是表示氯)。

尤其优选这样的式 (I-2) 化合物, 其中

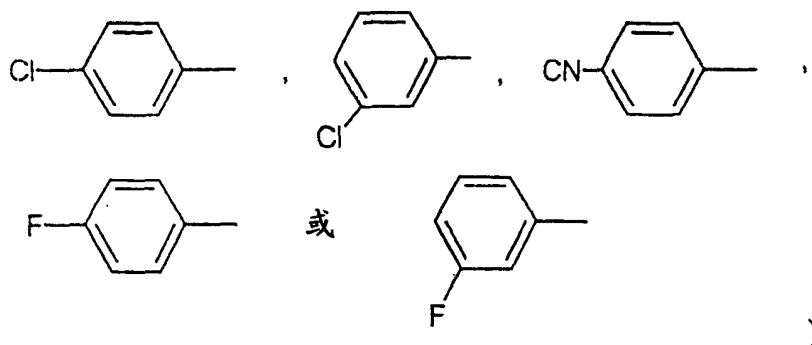
W 尤其优选表示氢、氯或甲基(特别强调的是表示氢或甲基),

X 尤其优选表示氯、甲基或乙基(特别强调的是表示甲基或乙基),

Y 尤其优选表示基团



(特别强调的是表示



V^1 尤其优选表示氯、氟、氰基或甲基,

V^2 尤其优选表示氢或氯,

Z 尤其优选表示氢或甲基,

A 尤其优选表示甲基、乙基、丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、环丙基、环戊基或环己基(特别强调的是表示甲基或异丙基),

B 尤其优选表示甲基, 或

A、B 和与它们相连的碳原子一起尤其优选表示饱和的 C_3 - C_8 -环烷基, 其中任选一个环单元被氧或硫替代和其任选被甲基或在 C_6 -环烷基的情况下也被乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基或异丁氧基单取代(特别强调的是表示 C_5 -或 C_6 -环烷基, 其中在 C_6 -环烷基的情况下任选一个环原子被氧替代并且其任选被甲基、三氟甲基、甲氧基或乙氧基单取代),

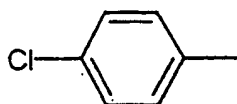
G 尤其优选表示氯。

尤其优选这样的式(I-3)化合物, 其中

W 尤其优选表示氢,

X 尤其优选表示氯或甲基(特别强调的是表示甲基),

Y 尤其优选表示基团



Z 尤其优选表示氢或甲基,

A、B 和与它们相连的碳原子一起尤其优选表示饱和的 C_3 - C_6 -环烷基, 其中任选一个环单元被氧替代和其任选被甲基或甲氧基取代(特别强调的是表示 C_6 -环烷基),

G 尤其优选表示氯。

上述描述的一般的基团定义或者在优选范围给出的基团定义或解释, 可以相互组合, 即各种范围和优选范围之间也可任意组合。它们适用于终产物, 也适用于相应的前体和中间体。

本发明优选这样的式(I)化合物, 其中含有上述作为优选给出的含义的组合。

本发明特别优选这样的式(I)化合物, 其中含有上述作为特别优选给出的含义的组合。

本发明十分特别优选这样的式(I)化合物, 其中含有上述作为十分特别优选给出的含义的组合。

饱和的或者不饱和的烃基, 如烷基或者烯基, 包括与杂原子连接的情况下, 如在烷氧基中, 只要可能, 各为直链的或支链的。

除非另有说明, 任选被取代的基团可以是被一或多取代的, 其中在多取代的情况下取代基可以相同或不同。

除了在制备实施例中提到的化合物外, 可特别提及下述式(I-1)化合物。

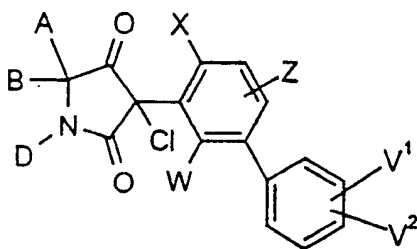
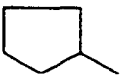
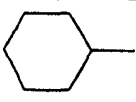


表1: $W = H; X = CH_3, V^1 = H, V^2 = H, Z = H$

A	B	D
CH ₃	H	H
C ₂ H ₅	H	H
C ₃ H ₇	H	H
i-C ₃ H ₇	H	H
C ₄ H ₉	H	H
i-C ₄ H ₉	H	H
s-C ₄ H ₉	H	H
t-C ₄ H ₉	H	H
CH ₃	CH ₃	H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₃ H ₇	CH ₃	H
i-C ₃ H ₇	CH ₃	H
C ₄ H ₉	CH ₃	H
i-C ₄ H ₉	CH ₃	H
s-C ₄ H ₉	CH ₃	H
t-C ₄ H ₉	CH ₃	H
	CH ₃	H
	CH ₃	H
	CH ₃	H
-(CH ₂) ₂ -		H
-(CH ₂) ₄ -		H

表续1:

A	B	D
	$-(\text{CH}_2)_5-$	H
	$-(\text{CH}_2)_6-$	H
	$-(\text{CH}_2)_7-$	H
	$-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(\text{CH}_2)_2-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{O}-(\text{CH}_2)_3-$	H
	$-(\text{CH}_2)_2-\text{S}-(\text{CH}_2)_2-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-(\text{CH}_2)_3-$	H
	$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHCH}_3-(\text{CH}_2)_2-$	H
	$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHC}_2\text{H}_5-(\text{CH}_2)_2-$	H
	$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHC}_3\text{H}_7-(\text{CH}_2)_2-$	H
	$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHi-C}_3\text{H}_7-(\text{CH}_2)_2-$	H
	$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHOCH}_3-(\text{CH}_2)_2-$	H
	$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHOC}_2\text{H}_5-(\text{CH}_2)_2-$	H
	$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHOC}_3\text{H}_7-(\text{CH}_2)_2-$	H
	$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHOi-C}_3\text{H}_7-(\text{CH}_2)_2-$	H
	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(\text{CH}_3)_2-(\text{CH}_2)_2-$	H
	$-\text{CH}_2-(\text{CHCH}_3)_2-(\text{CH}_2)_2-$	H

A	D	B
	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
	$-(\text{CH}_2)_4-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-\text{CH}_2-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-\text{CHCH}_3-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{S}-(\text{CH}_2)_2-$	H

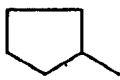
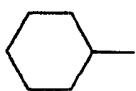
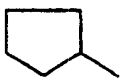
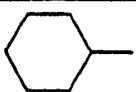
A	D	B
	$-(CH_2)_2-S-CH_2-$	H
	$ \begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---CH---} \\ \qquad \qquad \\ \text{---(CH}_2\text{)}_3\text{---} \end{array} $	H
H	CH ₃	H
H	C ₂ H ₅	H
H	C ₃ H ₇	H
H	i-C ₃ H ₇	H
H		H
H		H
H		H
H	CH ₃	CH ₃
H	C ₂ H ₅	CH ₃
H	C ₃ H ₇	CH ₃
H	i-C ₃ H ₇	CH ₃
H		CH ₃
H		CH ₃
H		CH ₃
H	CH ₃	C ₂ H ₅
H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅

表 2: A、B 和 D 如表 1 所述

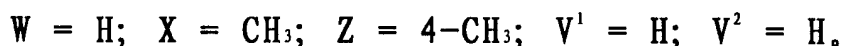


表 3: A、B 和 D 如表 1 所述

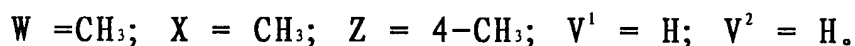


表 4: A、B 和 D 如表 1 所述

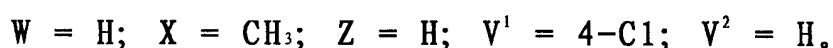


表 5: A、B 和 D 如表 1 所述

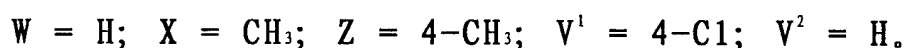


表 6: A、B 和 D 如表 1 所述

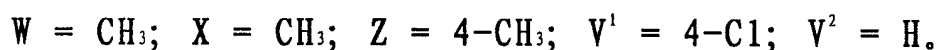


表 7: A、B 和 D 如表 1 所述

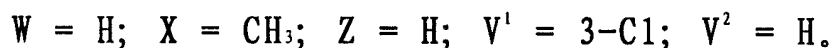


表 8: A、B 和 D 如表 1 所述

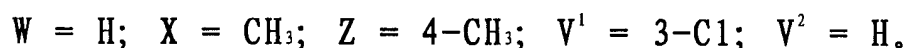


表 9: A、B 和 D 如表 1 所述

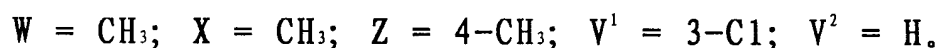


表 10: A、B 和 D 如表 1 所述

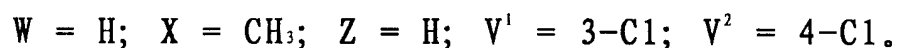


表 11: A、B 和 D 如表 1 所述

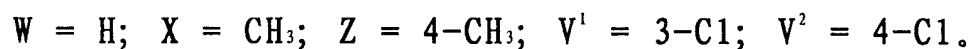


表 12: A、B 和 D 如表 1 所述

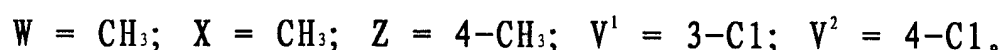
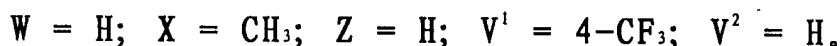
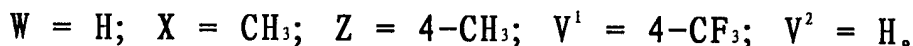
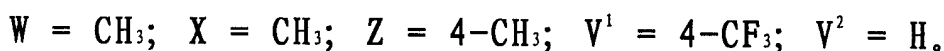
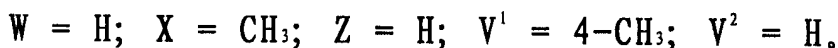
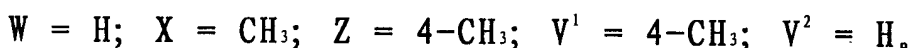
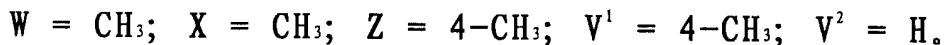
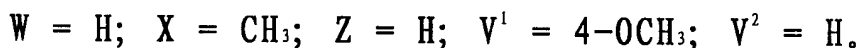
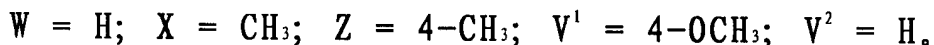
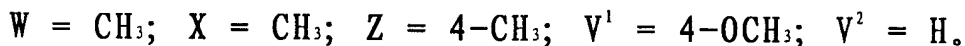


表 13: A、B 和 D 如表 1 所述表 14: A、B 和 D 如表 1 所述表 15: A、B 和 D 如表 1 所述表 16: A、B 和 D 如表 1 所述表 17: A、B 和 D 如表 1 所述表 18: A、B 和 D 如表 1 所述表 19: A、B 和 D 如表 1 所述表 20: A、B 和 D 如表 1 所述表 21: A、B 和 D 如表 1 所述

除了在制备实施例中提到的化合物外,可特别提及下述式(I-2)化合物。

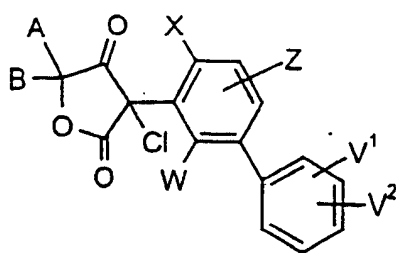


表 22: $W = H$; $X = CH_3$, $Z = H$, $V^1 = H$, $V^2 = H$.

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

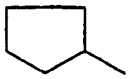
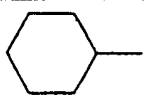
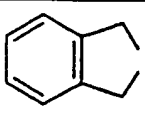
A	B
	CH ₃
	CH ₃
	CH ₃
-(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₄ -	
-(CH ₂) ₅ -	
-(CH ₂) ₆ -	
-(CH ₂) ₇ -	
-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	
-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -	
-(CH ₂) ₂ -S-(CH ₂) ₂ -	
-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₃ -	
-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	
(CH ₂) ₂ -CHC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -CHC ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -CHi-C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -CHOC ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -CHOi-C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -	
-CH ₂ -(CHCH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -	
	

表 23: A 和 B 如表 22 中所述

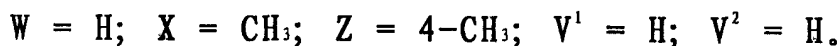


表 24: A 和 B 如表 22 中所述

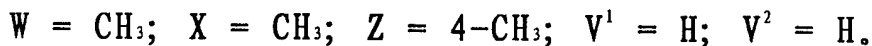


表 25: A 和 B 如表 22 中所述

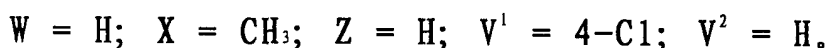


表 26: A 和 B 如表 22 中所述

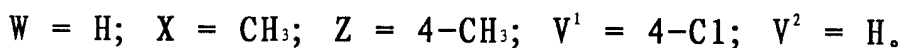


表 27: A 和 B 如表 22 中所述

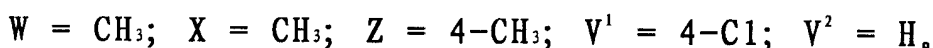


表 28: A 和 B 如表 22 中所述

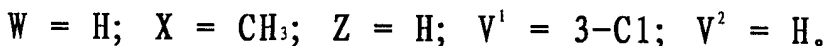


表 29: A 和 B 如表 22 中所述

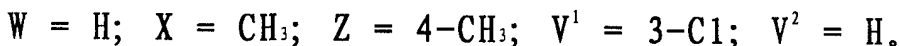


表 30: A 和 B 如表 22 中所述

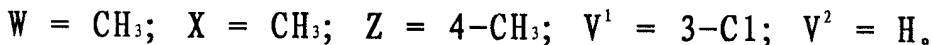


表 31: A 和 B 如表 22 中所述

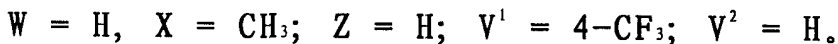


表 32: A 和 B 如表 22 中所述

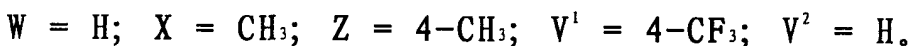


表 33: A 和 B 如表 22 中所述

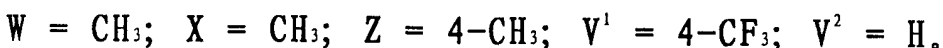


表 34: A 和 B 如表 22 中所述

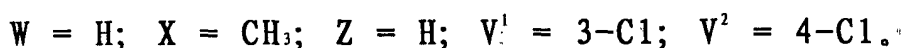


表 35: A 和 B 如表 22 中所述

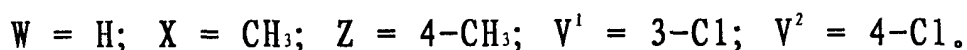


表 36: A 和 B 如表 22 中所述

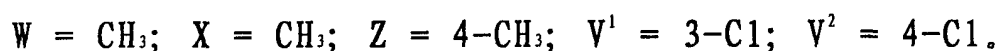


表 37: A 和 B 如表 22 中所述

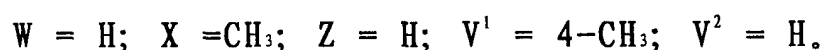


表 38: A 和 B 如表 22 中所述

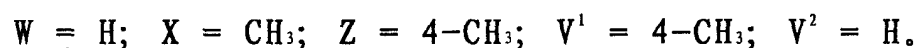


表 39: A 和 B 如表 22 中所述

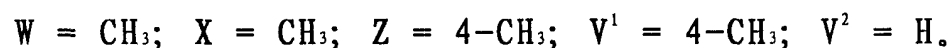


表 40: A 和 B 如表 22 中所述

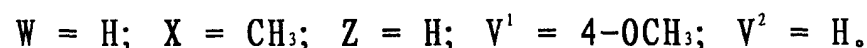


表 41: A 和 B 如表 22 中所述

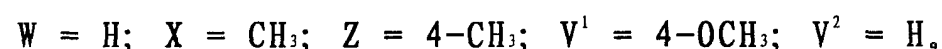
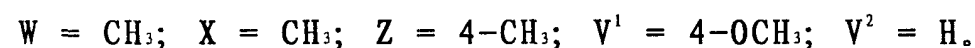
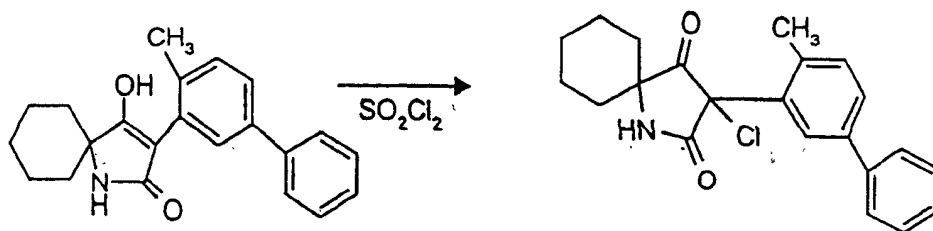


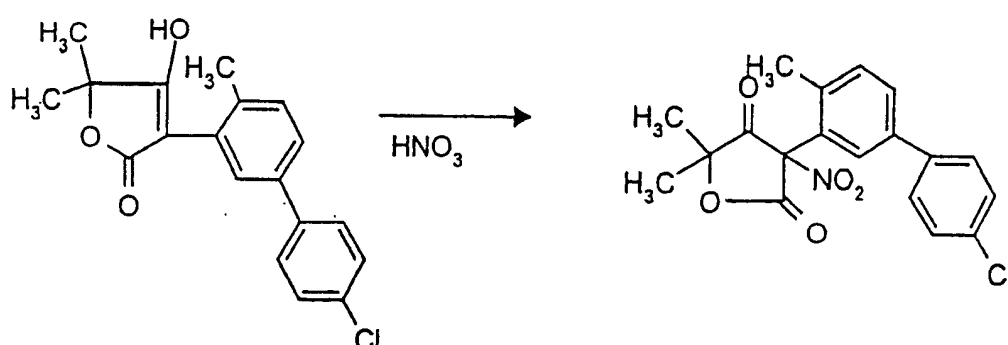
表 42: A 和 B 如表 22 中所述



按照方法(A), 如果应用 3-[(2-甲基-5-苯基)-苯基]-5,5-五亚甲基-4-羟基- Δ^3 -吡咯烷-2-酮作为原料。那么本发明方法的进程可用下述反应路线表示:



按照方法(B)，如果应用 3-[(2-甲基-5-(4-氯)-苯基)-苯基]-4-羟基-5,5-二甲基-Δ³-呋喃-2-酮，那么本发明方法的进程可用下述反应路线表示：



方法(A)的特征在于，式(II)化合物，其中 A、B、Q、W、X、Y 和 Z 具有上述含义，在稀释剂和卤化剂以及任选在自由基引发剂存在下反应。作为自由基引发剂例如可应用过氧化苯甲酰或偶氮双异丁腈。

在本发明方法(A)中，作为稀释剂可应用所有惰性有机溶剂。优选可应用烃类，例如苯、甲苯和二甲苯，以及醚类，如二丁基醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲基醚和二乙二醇二甲基醚，此外是卤代烃类，如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷、氯苯、二氯苯，以及酯类如乙酸乙酯。

用于方法(A)的卤化剂包括例如磺酰氯、磺酰溴、亚磺酰氯、亚磺酰溴、酰亚胺如 N-溴琥珀酰亚胺和 N-氯琥珀酰亚胺、氯磺酸以及次氯酸酯，例如叔丁基次氯酸酯。

在实施本发明方法(A)中的反应温度可以在较大范围内变化。一般地，反应温度为-40℃至 150℃，优选 0℃至 100℃。

本发明方法(A)一般在常压下进行。

在实施本发明方法(A)中，式(II)的反应组分和卤化剂一般以约等摩尔量应用。但也可以较大的过量(至多 3 摩尔)应用一种或另一种组

分。

方法(B)的特征在于,式(II)化合物,其中 A、B、Q、W、X、Y 和 Z 具有上述含义,在稀释剂存在下和在硝化剂存在下反应。

在本发明方法(B)中,作为稀释剂可应用所有惰性有机溶剂。优选可应用卤代烃类,如二氯甲烷、氯仿、二氯苯、二氯乙烷。

硝化剂可以是“硝化酸”,优选发烟硝酸。

在实施本发明方法(B)中的反应温度可以在较大范围内变化。一般地,反应温度为-50℃至 150℃,优选 0℃至 80℃。

本发明方法(B)一般在常压下进行。

在实施本发明方法(B)中,式(II)的反应组分与硝化剂一般以约等摩尔量应用。但也可以较大的过量(至多 5 摩尔)应用一种或另一种组分。

本发明活性化合物适用于保护植物或植物器官以提高产量、改进收获产品的质量以及用于防治动物害虫,特别是在农业、林业、花园、和休闲设施、仓库虫害防治和材料的保护以及卫生领域中发生的昆虫、蜘蛛类动物和线虫,同时具有很好的植物耐受性、对恒温动物的可接受的毒性和对环境友好。它们可优选被用作植物保护剂。它们对正常敏感和抗性种类以及对所有或某些发育阶段具有活性。上述害虫包括:

等足目,例如,潮虫(*Oniscus asellus*)、平甲虫、鼠妇。

倍足目,例如,具斑马陆。

唇足目,例如,食果地蜈蚣、蚰蜒属。

综合目,例如,庭园么蚰。

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、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,欧洲球蠹。

等翅目,例如,散白蚁属。

虱目,例如,体虱、血虱属、颚虱属、嚼虱属、畜虱属。

缨翅目,例如,温室条蓟马、烟蓟马、棕榈蓟马、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、椎猎蝽属。

同翅目，例如，甘蓝粉虱、甘薯粉虱、温室白粉虱、棉蚜、甘蓝蚜、茶隐瘤蚜、豆豉蚜、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、橄榄珠蜡蚧、灰飞虱、褐飞虱、红肾圆盾蚧、常春藤圆盾蚧、粉蚧属、木虱属。

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、葡萄果蠹蛾、茶长卷蛾、栎绿卷蛾、*Cnaphalocerus* 属、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、稻水象。

膜翅目，例如，松叶蜂属、实叶蜂属、毛蚁属、小家蚁、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、塘虱属(*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、斑潜蝇属。

蚤目，例如，印鼠客蚤、角叶蚤属。

蛛形纲，例如，蝎(*Scorpio maurus*)、红斑蛛、粗脚粉螨、锐缘蜱属、纯缘蜱属、鸡皮刺螨、兔瘰螨、柑橘皱叶刺瘰螨、牛蜱属、扇头蜱属、花蜱属、璃眼蜱属、硬蜱属、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、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、伞滑刃线虫属。

本发明化合物在一定的浓度或用量下还可任选用作除草剂和杀微生物剂，例如用作杀真菌剂、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农作物(包括自然长出的农作物)。农作物可以通过常规植物育种和优化方法或通过生物技术和重组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可获得或不能获得植物品种保护的植物品种，植物的部分应理解为植物的所有地上和地下部分以及器官，如茎、叶、花和根，可提及的实例为叶片、针叶、叶柄、树干、花、子实体、果实、种子、根、块茎和根状茎。植物各部分还包括收获材料以及无性和有性繁殖材料，例如插条、块茎、根状茎、压枝和种子。

采用活性化合物进行植物和植物部分的本发明处理方法是通过对常规处理方法直接施用或将化合物作用于它们的环境、栖息地或贮藏区进行处理，例如浸渍、喷雾、熏蒸、弥雾、撒播、刷涂、注入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。

本发明活性化合物可被转化成为常规制剂如溶液剂、乳剂、可湿性粉剂、悬浮剂、粉剂、细粉剂、糊剂、可溶性粉剂、颗粒剂、浓悬浮乳剂、用活性化合物浸渍的天然和合成材料以及聚合物包封的微胶囊剂。

这些制剂是以已知方法制备的，例如通过将活性化合物与增量剂，即液体溶剂和/或固体载体混合而生产，制剂中任选使用表面活性剂，即乳化剂和/或分散剂和/或发泡剂。

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。适合的液体溶剂主要有：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、氯乙烯或二氯甲烷；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。

适合的固体载体有：

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，以及合成的无机和有机粉末颗粒，以及有机材料的颗粒如锯末、坚果壳、玉米穗茎和烟草茎；适合的乳化剂和/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：例如木素亚硫酸废液和甲基纤维素。

在制剂中还可使用粘着剂如羧甲基纤维素和粉末、颗粒或胶乳状的天然或合成聚合物，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。其它添加剂可以是矿物油和植物油。

可以使用着色剂如无机颜料，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0.5-90%的活性化合物。

本发明活性化合物也可以其本身或在其制剂中与已知的杀真菌剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂或杀虫剂混合应用，以例如拓宽活性谱或者避免产生抗性。由此，在很多情况下可以获得协同效应，即混合物的活性大于单个组分的活性。

作为混合组分例如可考虑如下化合物：

杀真菌剂：

Aldimorph，氯丙膦酸、氯丙膦酸钾、Andoprim、敌菌灵、戊环唑、腈嘧菌酯，

苯霜灵、麦锈灵、苯菌灵、苄烯酸、苄烯酸-异丁酯、双丙氯酞膦、乐杀螨、联苯、双苯三唑醇、灭瘟素、糠菌素、磺嘧菌灵、粉病定，

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、清菌脲、环唑醇、环丙嘧啶、酯菌胺，

双乙氧咪唑威、双氯酚、苄氯三唑醇、Diclofluanid、哒菌清、氯硝胺、乙霉威、噁醚唑、甲菌定、烯酰吗啉、烯唑醇、烯唑醇-M、敌螨普、二苯胺、吡菌硫、灭菌磷、二噻农、吗菌灵、多果定、敌菌酮,

克瘟散、氧唑菌、乙环唑、乙菌定、氯唑灵,

噁唑酮菌、菌拿灵、异噻菌醇、腈苯唑、呋菌胺、种衣酯、拌种咯、苯锈定、丁苯吗啉、薯瘟锡、毒菌锡、福美铁、噻菌胺、氟定胺、氟联苯菌(Flumetover)、氟菌安、喹唑菌酮、调噻醇、氟硅唑, 磺菌胺、氟酰胺、粉唑胺、灭菌丹、藻菌磷(Fosetyl-Aluminium)、藻菌磷(Fosetyl-Natrium)、四氯苯酞、麦穗宁、呋氨丙灵、呋吡唑灵、灭菌安(Furcarbonil)、呋菌唑、呋醚唑、拌种胺、双胍盐、六氯苯、己唑醇、噁霉灵,

烯菌灵、酰胺唑、双胍辛(Iminoctadin)、双胍辛对十二烷基苯磺酸盐(Iminoctadinealbesilate)、双胍辛醋酸盐、Iodocarb、环戊唑醇、异稻瘟脞(IBP)、异丙定、Irumamycin、富士一号、氯苯咪菌酮, 春雷霉素、亚胺菌、铜制品, 如, 氢氧化铜、环烷酸铜、氯化铜、硫酸铜、氧化铜、喹啉铜、和碱式硫酸铜混合物,

锰铜混剂、代森锰锌、代森锰、Meferimzone、噻菌胺、丙氧灭锈胺、甲霜灵、环戊唑菌、磺菌威、甲呋菌胺、代森联、苯吡洛菌(Metomeclam)、噻菌胺、米多霉素、腈菌唑、甲菌利,

福美镍、异丙消、氟苯嘧啶醇,

甲呋酰胺、噁霜灵、Oxamocarb、喹菌酮、氧化萎锈灵(Oxycarboxim)、Oxyfenthiin,

多效唑、稻瘟酯、戊菌唑、戊菌隆、双氯苯磷、多马霉素、Picoxystrobin、粉病灵、多氧霉素、Ployoxorim、噻菌灵、丙氯灵、杀菌利、百维灵、Propanosine-Natrium、丙环唑、甲基代森锌、Pyraclostrobin、定菌磷、啉斑脞、二甲噻菌胺、咯喹酮、氯吡呋醚, 唑喹菌酮、五氯硝基苯(PCNB),

硫和硫制剂,

戊唑醇、叶枯酞、四氯硝基苯、调环烯、氟醚唑、涕必灵、噻菌脞、溴氟唑菌、甲基托布津、福美双、硫氟苯甲酰胺、甲基立枯磷、对甲抑菌灵、三唑酮、菌唑醇、叶锈特、唑菌嗪、杨菌胺、三环唑、

克啉菌、Trifloxystrobin、氟菌唑、噻氧灵、戊叉唑菌，

烯效唑，

有效霉素、烯菌酮、烯霜苄唑，

氟菌胺、代森锌、福美锌以及

咪草酯 G、OK-8705、OK-8801，

α -(1,1-二甲基乙基)- β -(2-苯氧基乙基)-1H-1,2,4-三唑-1-乙醇，

α -(2,4-二氯苯基)- β -氟-b-丙基-1H-1,2,4-三唑-1-乙醇，

α -(2,4-二氯苯基)- β -甲氧基-a-甲基-1H-1,2,4-三唑-1-乙醇，

α -(5-甲基-1,3-二噁烷-5-基)- β -[[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，

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(pyrrolidinol)，

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(carboxanilid)，

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-(甲基硫基)-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)-苄基]-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,
2-[[6-去氧-4-O-(4-O-甲基-β-3-D-吡喃葡萄糖苷基)-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)-戊烷二腈,
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, 6-二甲基苄基-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)-苄基]-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-茚-2-腈,
3-[2-(4-氯苄基)-5-乙氧基-3-异噁唑烷基]-吡啶,
4-氯-2-氟基-N, N-二甲基-5-(4-甲基苄基)-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-2-甲胺,
8-羟基喹啉硫酸盐,
9H-咕吨-9-甲酸-2-[(苄基氨基)-羰基]-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,
顺-1-(4-氯苄基)-2-(1H-1, 2, 4-三唑-1-基)-环庚醇,
顺-4-[3-[4-(1, 1-二甲基丙基)-苄基-2-甲基丙基]-2, 6-二甲基-吗啉盐酸盐,
[(4-氯苄基)-偶氮]-氟基乙酸乙酯,
碳酸氢钾,
甲烷四硫醇钠盐,
1-(2, 3-二氢-2, 2-二甲基-1H-茚-1-基)-1H-咪唑-5-甲酸甲酯,

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,
 N-(2,6-二甲基苯基)-2-甲氧基-N-(四氢-2-氧代-3-呋喃基)-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,
 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,
 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-丙炔基氧基)-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,
 0,0-二乙基-[2-(二丙基氨基)-2-氧代乙基]-乙基硫代氨基磷酸酯(ethylphosphoramidothioat)

0-甲基-S-苯基-苯基丙基硫代氨基磷酸酯,
 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,
 4-[(3,4-二甲氧基苯基)-3-(4-氟苯基)-丙烯酰基]-吗啉
 杀菌剂:

溴硝丙二醇、双氯酚、氯定、福美镍、春雷霉素、异噻菌酮、呋喃甲酸、土霉素、噻菌灵、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、灭螨醌、氯丙菊酯、棉铃威、涕灭威、涕灭砒威、甲体氯氰菊酯(Alphacypermethrin)、甲体氯氰菊酯(Alphamethrin)、双甲脒、齐墩螨素、AZ 60541、艾扎丁、甲基吡啶磷、谷硫磷A、谷硫磷M、三唑锡,

波林杆菌芽孢、Bacillus sphaericus、柯敌克菌、苏金杆菌、

Baculoviruses、Beauveria bassiana、Beauveria tenella、噁虫威、丙硫克百威、杀虫磺、苯螨特、 β -氯氯菊酯、联苯肼酯、联苯菊酯、Bioethanomethrin、生物氯菊酯、Bistrifluron、BPMC、溴硫磷 A、合杀威、噻嗪酮、特密硫磷、丁酮威、丁基吡啶灵 (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、氯啉脲、氯甲硫磷、毒死蜱、毒死蜱 M、Chlovaporthrin、Chromafenozide、顺式灭虫菊 (Cis-Resmethrin)、Cispermethrin、Clopythrin、除线威、四螨嗪、Clothianidine、杀螟腈、Cycloprene、乙氧菊酯、氯氯菊酯、氯氯菊酯、三环锡、氯菊酯、灭蝇胺，

溴氯菊酯、内吸磷 M、内吸磷 S、甲基内吸磷、丁醚脲、二嗪磷、敌敌畏、氯脲杀、开乐散、乐果、甲基毒虫畏、Dinotofuran、苯虫醚、乙拌磷、碘酞丁二辛、苯氧炔螨、

Eflusilanate、Emamectin、右旋烯炔菊酯、硫丹、Entomophthora spp.、高氯戊菊酯、苯虫威、Ethiprole、乙硫磷、灭克磷、醚菊酯、特苯噁唑、氧啉啉磷，

克线磷、啞螨醚、杀螨锡、杀螟硫磷、苯硫威、Fenoxacrim、双氧威、甲氧菊酯、Fenpyrad、Fenpyrithrin、唑螨酯、倍硫磷、杀灭菊酯、锐劲特、氯啉脲、氯啉蜱脲、Flubrocycythrinate、氯蜱脲、氯氯戊菊酯、氯虫脲、氯氯苯菊酯、Flupyrzofos、Flutenzine、氯胺菊酯、地虫磷、丁苯硫磷、噻唑酮磷、Fubfenprox、呋线威，

颗粒层增殖病毒，

特丁苯酰肼、HCH、庚虫磷、氯铃脲、噻螨酮、烯虫乙酯，

吡虫啉、噁二唑虫、氯唑磷、丙胺磷、异噁唑磷、齐墩螨素，

核多角体病毒，

氯氯菊酯、氯丙氧脲，

马拉硫磷、灭蚜磷、四聚乙醛、甲胺磷、Metharhizium anisopliae、Metharhizium flavoviride、杀扑磷、灭虫威、蒙五一五、灭多虫、甲氧苯酰肼、速灭威、噁虫酮、速灭磷、米尔螨素、Milbemyein、久效磷，

二溴磷、硝胺烯啶、硝虫噻嗪、双苯氯脲，

氧乐果、甲胺叉威、砒吸磷，

Paecilomyces fumosoroseus、对硫磷 A、甲基对硫磷、氯菊酯、稻丰散、甲拌磷、伏杀磷、亚胺硫磷、磷胺、辛硫磷、抗蚜威、虫螨磷 A、甲基虫螨磷、丙溴磷、克螨特、猛杀威、残杀威、丙硫磷、发果、拒嗪酮、吡唑硫磷、反灭虫菊、除虫菊、哒螨酮、pyridathion、噻胺苯醚、蚊蝇醚，

喹噁磷，

Ribavirin，

杀抗松、硫线磷、灭虫硅醚、艾克敌、Spirodiclofen、治螟磷、乙丙硫磷，

氟胺氟菊酯、双苯酰肼、吡螨胺、噻丙磷(Tebupirimiphos)、氟虫隆、七氟菊酯、双硫磷、灭虫威、特丁磷、杀虫威、三氯杀螨砒、辛体氟氟菊酯、噻虫啉(Thiacloprid)、Thiamethoxam、蛾蝇腈、Thiatriphos、硫环杀、硫双威、久效威、敌贝特、溴氟氟菊酯、四溴菊酯、苯螨噻、唑蚜威、三唑磷、Triazuron、Trichlophenidine、敌百虫、杀虫隆、混杀威，

蚜灭多、氟吡唑虫、麦柯特，

YI 5302，

Zeta-cypermethrin、Zolaprofos，

2, 2-二甲基环丙烷甲酸(1R-顺)-[5-(苯基甲基)-3-呋喃基]-甲基-3-[(二氢-2-氧代-3(2H)呋喃亚基)-甲基]酯，

2, 2, 3, 3-四甲基环丙烷甲酸[(3-苯氧基苯基)-甲基]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，

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-(乙酰基氧基)-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，

丙基氨基甲酸(3-甲基苯基)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]硫基]-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,

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

苏云金杆菌菌株 EG-2348,

苯甲酸[2-苯甲酰基-1-(1,1-二甲基乙基)-酰肼],

丁酸[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]酯,

[3-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-噻唑烷亚基]-氨基氰,

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-1-(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,

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-胍二硫代甲酰胺,

N-甲基-N'-2-丙烯基-1,2-胍二硫代甲酰胺,

0,0-二乙基-[2-(二丙基氨基)-2-氧代乙基]-乙基硫代氨基磷酸酯,

N-氟基甲基-4-三氟甲基-烟酰胺

3,5-二氯-1-(3,3-二氯-2-丙烯基氧基)-4-[3-(5-三氟甲基吡啶-2-基氧基)-丙氧基]-苯。

与其它已知活性化合物例如除草剂或肥料以及生长调节剂、安全剂或半化学品(Semichemicals)的混合物也是可能的。

当用作杀虫剂时,本发明活性化合物可以以其市售制剂和由上述制剂制备的应用形式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。

此外,在应用中,本发明活性物质可在其市售制剂以及在由这些制剂制备的应用形式中作为杀虫剂与抑制剂混合存在,所述抑制剂降

低活性物质在应用后于植物环境中、植物部分的表面上或在植物组织中降解。

由市售制剂制备的应用形式中活性化合物的含量可以在很宽的范围内变化。使用形式中活性化合物的浓度为 0.0000001-95 重量%、优选 0.0001-1 重量%。

以适用于应用形式的常规方法进行使用。

当用于防治卫生害虫和仓库害虫防治时，活性化合物具有优良的木材和粘土残留活性以及对刷有石灰的基底具有很好的碱稳定性。

如上所提及，可按照本发明处理所有植物及其部分。在一个优选的实施方案中，处理已有的或通过常规的生物育种方法，如杂交或原生质体融合得到的植物种类和植物品种和其部分。在另一个优选的实施方案中，处理通过基因工程方法，任选与常规方法联合(基因修饰生物体)得到的转基因植物和植物品种及其部分。术语“部分”或“植物的部分”或“植物部分”在上面已作过解释。

按照本发明，特别优选处理在各种情况下市售可得的或在使用的植物品种的植物。植物品种应理解为表示具有新的特征(“特性”)，并且已通过常规育种、通过诱变或通过重组 DNA 技术获得的植物。它们可以是品种型、生物属型或基因型。

根据植物种类或植物品种、它们的栖息地和生长条件(土壤、气候、植物生长期、营养)，按照本发明的处理方法还可导致超加和的(“协同”)作用。因此，例如，可减少用量和/或拓宽活性谱和/或提高本发明所用的物质和组合物的活性、改善植物生长、增强对高或低温的耐受性、增强对旱灾或水灾或土壤盐量的耐受性、增加花卉的性能、易于收获、加速成熟、提高收获量、提高收获产品的质量和/或提高产品的营养价值、提高产品的储存稳定性和/或可加工性，这些超出了本身所期望的效果。

属于按照本发明优选进行处理的转基因植物或植物品种(即通过基因工程得到的那些)包括通过基因材料的基因工程修饰得到的所有植物，所述基因修饰赋予这些植物特别有利的有用的性能(“特性”)。这种性能的例子是较好的植物生长、增强对高或低温的耐受性、增强对旱灾或水灾或土壤盐量的耐受性、增加花卉的性能、易于收获、加速成熟、较高的收获产量、收获产品较好的质量和/或较高的营养价

值、收获产品较好的储存稳定性和/或可加工性。进一步和特别强调的所述性能的例子是提高植物对动物和微生物害虫，如昆虫、螨、植物致病真菌、细菌和/或病毒的抵御性，以及提高植物对某些除草活性化合物的耐受性。可提及的转基因植物的例子是重要的农作物，如谷类农作物(小麦、稻)、玉米、大豆、土豆、棉花、烟草、油菜籽油菜和水果植物(水果为苹果、梨、柑橘属水果和葡萄)，特别强调的是玉米、大豆、土豆、棉花、烟草和油菜籽油菜。特别强调的特性是通过在植物中产生的毒素，特别是通过来自 *Thuringiensis* 杆菌的基因物质(例如通过基因 CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb 和 CryIF 及它们的联合)(下文称作“Bt 植物”)在植物中产生的那些增强植物对昆虫、蜘蛛类动物、线虫和蜗牛的抵御。还特别需要强调的特性是提高通过系统获得的抗性(SAR)、系统素(Systemin)、植物抗毒素、Elicitorin 和抗性基因以及相应表达的蛋白和毒素来抗真菌、细菌和毒素的植物防护作用。此外，特别强调的特性是植物对某些除草活性化合物，如咪唑啉酮类、磺酰脲类、草甘膦类或膦基麦黄酮(例如“PAT”基因)的增强的耐受性。给予所述的需要的特性的基因也可以在转基因植物中相互联合存在。可提及的“Bt 植物”的例子是以商标名 YIELD GARD®(例如玉米、棉花、大豆)、KnockOut®(例如玉米)、StarLink®(例如玉米)、Bollgard®(棉花)、Nucotn®(棉花)和 Newleaf®(土豆)出售的玉米品种、棉花品种、大豆品种和土豆品种。可提及的耐受除草剂的植物是以商标名 Roundup Ready®(耐受草甘膦，例如玉米、棉花、大豆)、Liberty Link®(耐受膦基麦黄酮，例如油菜籽油菜)、IMI®(耐受咪唑啉酮类)和 STS®(耐受磺酰脲类，例如玉米)出售的玉米品种、棉花品种、大豆品种。可提及的耐除草剂的植物(以常规方式除草剂耐受育种)包括以商标名 Clearfield®(例如玉米)出售的品种。当然，这些叙述也适用于具有所述特性或将来还要改良的基因特性的将来开发的植物或将来投放市场的植物品种。

所列的植物可按照本发明以特别有利的方式用本发明通式(I)的活性化合物或者本发明的活性混合物进行处理。上述优选的活性化合物或混合物范围也适用于这些植物的处理。特别强调的是用本文中特别提及的化合物或混合物处理植物。

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，例如硬蜱、软蜱、兽疥癣螨、虱状蒲螨、蝇(叮咬和吸食)、寄生性蝇幼虫、虱、毛虱、羽虱和跳蚤。这些寄生虫包括：

虱目，例如，血虱属、顎虱属、虱属、*Pthirus* spp.、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、猫羽虱属；

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.、虻蝇属；

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、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、钝缘蜱属、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、瓦螨属；

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、瘡螨属、痒螨属、耳螨属、疥螨属、痂螨属、疣螨属、胞螨属、皮膜螨属。

本发明的式(I)活性化合物也适用于防治侵扰农业家畜的节肢动物，所述农业家畜如牛、绵羊、山羊、马、猪、驴、骆驼、水牛、兔、鸡、火鸡、鸭、鹅、蜜蜂，其它家养动物，例如狗、猫、笼养鸟、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)的情况，因此，通过使用本发明的式(I)活性化合物可以使畜牧业管理更经济而简便。

应用于兽医领域时,本发明式(I)活性化合物可通过已知方法即经肠给药,例如以片剂、胶囊剂、饮剂、灌药剂、颗粒剂、膏剂、大丸剂、喂食方法、栓剂等形式给药;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),植入法给药;经鼻给药;经皮肤给药,例如以浸泡或药浴、喷雾、泼浇、擦、洗刷、撒粉方式给药,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、装饰器具等给药。

当用于家畜、家禽、宠物等时,可将式(I)活性化合物作为含有1-80重量%的活性化合物的制剂形式(例如粉剂、乳剂、流动剂)直接或100-10,000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

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。

革翅目,例如

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、内华达古白蚁、台湾乳白蚁。

缨尾目,例如台湾衣鱼。

本发明意义上的工业材料可以理解为表示无生命材料,例如优选合成材料、粘合剂、胶、纸和板、皮革、木材、木制品和涂料。

木材以及木制品是特别需要优选保护使其免受昆虫侵袭的材料。

可用本发明组合物或含有本发明组合物的混合物保护的木材和木

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、桥型码头、木制交通工具、箱子、货架、集装箱、电话线杆、木外罩、木窗和木门、胶合板、粗纸板、在房屋建筑或建筑细木工行业中常用的细木工或木制品。

所述活性化合物可直接,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、抗水剂混合,以及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。

用于保护木材和木制品的杀虫组合物或浓缩物中包括0.0001至95重量%,特别是0.001至60重量%浓度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的种类和个体密度以及介质而确定的。最佳施用量各自可在应用时通过系列试验确定。然而基于需保护的材料,通常使用0.0001至20重量%,优选0.001至10重量%的活性化合物是足够的。

适合的溶剂和/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化学溶剂或溶剂混合物和/或极性有机化学溶剂或溶剂混合物和/或水,如需要可加入乳化剂和/或湿润剂。

优选使用的有机化学溶剂是油性或油类溶剂,其蒸发值大于35以及闪点大于30℃,并优选大于45℃。用作上述低挥发度以及不溶于水的油性和油类溶剂物质是相应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。

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。

在一个优选实施方案中,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程混合物和/或锭子油和/或一氯代萘,优选 α -一氯代萘。

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易挥发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

℃，以及该杀虫剂-杀菌剂混合物可溶或可乳化于上述溶剂混合物中。

在优选实施方案中，部分有机化学溶剂或溶剂混合物被脂族极性有机化学溶剂或溶剂混合物替代。优选使用含有羟基和/或酯基和/或醚基的脂族有机溶剂，例如乙二醇醚、酯等。

本发明使用的有机化学粘合剂是合成树脂和/或粘合干性油，它们本身已知可用水稀释和/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的或包含下列物质的粘合剂丙烯酸树脂、乙烯基树脂，例如聚乙酸乙烯酯、聚酯类树脂、缩聚或加聚树脂、聚氨酯树脂、醇酸树脂或改性的醇酸树脂、酚醛树脂、烃类树脂，如茛/香豆酮树脂、有机硅树脂、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。

用作粘合剂的合成树脂可以乳剂、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。

上述粘合剂可全部或部分被固定剂(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(以使用的粘合剂为100%计)。

增塑剂选自邻苯二甲酸酯类的化学物质，如邻苯二甲酸二丁酯、邻苯二甲酸二辛酯或邻苯二甲酸苄基丁基酯；磷酸酯类如磷酸三丁酯；己二酸酯，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类，如聚乙烯基甲基醚或酮类，如二苯甲酮和亚乙基二苯甲酮。

其它适用的溶剂或稀释剂特别是水，任选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。

特别有效的木材保护方法是通过大批量的浸渍方法，例如通过真空、双真空或加压方法达到。

现用制剂还可任选包含其它的杀虫剂和任选其它的一种或多种杀

菌剂。

其它的共混组分优选包括在 W0 94/29 268-中提及的杀虫剂和杀菌剂。将在这些文献中提及的化合物引入本文并作为本申请的一部分。

十分特别优选的共混组分可以是杀虫剂，如毒死蜱、腈肟磷、灭虫硅醚(Silafluofin)、甲体氯氟菊酯、氟氯氟菊酯、氯氟菊酯、溴氟菊酯、氯菊酯、吡虫啉、NI-25、氟虫脲、氟铃脲、四氟菊酯、噻虫啉、Methoxyphenoxid、杀虫隆、Chlothianidin、艾克敌 105、七氟菊酯，以及杀菌剂，如 Epoxyconazole、己唑醇、戊环唑、丙环唑、戊唑醇、环唑醇、环戊唑菌、烯菌灵、抑菌灵、对甲抑菌灵、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。

同样，本发明的活性化合物可用于保护经常与海水或盐水接触的各种物品，如船体、滤器、网、船体结构、锚和信号装置免受生物附着。

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附着增加了船体的摩擦阻力并由于增加了能源消耗以及此外经常滞留于船坞，这样明显增加了运营成本。

此外附着生物还有海藻，例如水云属和仙菜属，特别重要的是定居性软甲亚纲(昆甲类)的附着，该昆甲类包括在蔓足纲(蔓足类甲壳动物)中。

令人惊奇地，现已发现本发明的活性化合物本身或者与其它活性物质的组合具有突出的防污(抗植被)作用。

通过使用本发明的活性化合物本身或者与其它活性物质组合，可以不使用重金属，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、氧化亚铜、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、苯基-(联吡啶)-三氯化铋、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酸酯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亚铜、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。

即用防污漆还可任选包含其它活性化合物，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。

下列组分优选用于本发明防污组合物的混合组分：

杀藻剂，如

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、草藻灭、醋酸三苯基锡、异丙隆、噻唑隆、乙氧氟草醚、灭藻醌和特丁净，

杀菌剂，如

苯并[b]噻吩甲酸环己基酰胺-S,S-二氧化物、抑菌灵、Fluorfolpet、3-碘-2-丙炔基丁基氨基甲酸酯、对甲抑菌灵和唑类，如戊环唑、环唑醇、氧唑菌、己唑醇、环戊唑菌、丙环唑和戊唑醇；

杀软体动物剂，如

醋酸三苯基锡、四聚乙醛、灭虫威、贝螺杀、硫双威和混杀威、Fe-螯合物；

或常用防污活性化合物，如

4,5-二氯-2-辛基-4-异噻唑啉-3-酮、二碘甲基paratryl砒、2-(N,N-二甲基硫代氨基甲酰基硫基)-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腈、二硫化四甲基秋兰姆和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例如 Ungerer, Chem. Ind. 1985, 37, 730-732 和 Williams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973 中公开的常用组分。

除了杀藻、杀菌、杀软体动物活性化合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树脂、水分散体形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。

涂料中还任选可包含优选不溶于海水的无机颜料、有机颜料或染料。涂料中还可包括如松香类物质，以使活性化合物可防治地释放。此外，涂料中可以包含增塑剂，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。

本发明的活性化合物还适于防治封闭空间，如公寓、厂房、办公室、车厢等空间中发生的有害动物，特别是昆虫、蜘蛛和螨。它们本身或与其它活性物质和助剂组合可通过被加入用于防治上述害虫的家用杀虫剂产品中使用。它们对敏感和抗性种群以及所有发育阶段都有杀虫活性。这些有害动物包括：

蝎目，例如钳蝎 (*Buthus occitanus*)。

蜱螨目，例如波斯锐缘蜱、翘缘锐缘蜱、苔螨属、鸡皮刺螨、家食甜螨、非洲钝缘蜱、血红扇头蜱、恙螨 (*Trombicula alfreddugesi*)、*Neutrombicula autumnalis*、屋尘螨、粉尘螨。

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。

倍足目，例如具斑马陆、山蛭虫属。

唇足目，例如地蜈蚣属。

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

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，例如欧洲球蝽。

等翅目，例如木白蚁属、散白蚁属。

啮虫目，例如 *Lepinatus* 属、粉啮虫属。

鞘翅目，例如圆皮蠹属、毛皮蠹属、皮蠹属、长头谷蠹、隐跗郭公虫属、蛛甲属、谷蠹、谷象、米象、玉米象、药材甲。

双翅目，例如埃及伊蚊、白纹伊蚊、*Aedes taeniorhynchus*、按蚊属、红头丽蝇、高额麻蝇、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。

在家用杀虫剂领域的应用通过它们本身或者与其它合适的活性物质，如磷酸酯类、氨基甲酸酯类、拟除虫菊酯类、新烟碱类(Neonicotinoiden)、生长调节剂类或其它已知杀虫剂类的活性化合物联合进行。

它们可以如下述使用：气溶胶，非增压喷雾剂，例如泵喷雾、喷洒喷雾、烟雾发生器、浓雾、泡沫、凝胶、带有纤维素或聚合物制成的蒸发片的蒸发产品、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、捕蛀虫纸、捕蛾袋和捕虫胶、作为颗粒剂或粉剂、在撒布饵料中或饵料位置。

本发明的活性化合物也可作为脱叶剂、干燥剂、除稻草剂，并且特别是作为除杂草剂应用。杂草在最宽的意义上应理解为在不希望的地方生长的所有植物。本发明的活性化合物是作为完全还是选择性的除草剂起作用主要取决于用量。

本发明活性化合物可用于例如下列植物：

以下各属的双子叶杂草：苘麻属、苋属、豕草属、*Anoda*、春黄菊属、*Aphanes*、滨藜属、雏菊属、鬼针草属、芥属、飞廉属、决明属、矢车菊属、藜属、薊属、旋花属、曼陀罗属、金钱草属、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、夜芝麻属、独行菜属、母草属、母菊属、薄荷属、山靛属、羊鱼属(*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、焊菜属、水松叶属、酸模属、猪毛菜属、千里光属、田菁属、黄花稔属、芸苔属、茄属、苦苣菜属、尖瓣花属、繁缕属、蒲公英属、遏蓝菜属、三叶草属、荨麻属、婆婆纳属、堇菜属、苍耳属。

以下各属的双子叶农作物：落花生属、甜菜属、芥属、黄瓜属、南瓜属、向日葵属、胡萝卜属、大豆属、棉属、番薯属、莴苣属、亚麻属、番茄属、烟草属、菜豆属、豌豆属、茄属、野豌豆属。

以下各属的单子叶杂草：山羊草属、冰草属、翦股颖属、看麦娘属、Apera、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、千斤子属、毒麦属、雨久花属、黍属、雀稗属、鹧草属、梯牧草属、早熟禾属、筒轴茅属、慈菇属、厂草属、狗尾草属、蜀黍属。

以下各属的单子叶农作物：葱属、菠萝属、天门冬属、燕麦属、大麦属、稻属、黍属、甘蔗属、黑麦属、高粱属、黑小麦属、小麦属、玉蜀黍属。

然而，本发明活性化合物的应用决不限于这些属的植物，还可以以相同方式延伸到其它植物。

取决于浓度，本发明活性化合物适合于用于完全防治杂草，例如在工业区、铁路轨道和在路面上以及有或没有树木的区域。同样，本发明活性化合物可用于防治在多年生植物，例如森林、绿化树木、果园、葡萄园、柑桔林、坚果园、香蕉种植园、咖啡种植园、茶种植园、橡胶种植园、油棕种植园、可可种植园、浆果种植园和啤酒花种植园、草地、体育场草坪和牧场中的杂草，以及用于选择性防治一年生植物中的杂草。

本发明式(I)化合物具有强的除草活性并且在应用于土壤和应用与地表植物部分具有宽的活性谱。在一定范围内它们也适用于在单子叶和双子叶农作物中，以及在出苗前方法，也可以在出苗后方法中选择性防治单子叶和双子叶杂草。

在一定浓度或用量下，本发明活性化合物也可用于防治有害动物和真菌或细菌性植物病害。它们也可任选被用于作为中间体或前体用于合成其它活性化合物。

本发明活性化合物可被转化成为常规制剂如溶液剂、乳剂、可湿性粉剂、悬浮剂、粉剂、细粉剂、糊剂、可溶性粉剂、颗粒剂、浓悬浮乳剂、用活性化合物浸渍的天然和合成材料以及聚合物包封的微胶囊剂。

这些制剂是以已知方法制备的，例如通过将活性化合物与增量剂，即液体溶剂和/或固体载体混合而生产，制剂中任选使用表面活性剂，即乳化剂和/或分散剂和/或发泡剂。

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。适合的液体溶剂主要有：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、氯乙烯或二氯甲烷；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。

适合的固体载体有：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，以及合成的无机和有机粉末颗粒，以及有机材料的颗粒如锯末、坚果壳、玉米穗茎和烟草茎；适合的乳化剂和/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：例如木素亚硫酸废液和甲基纤维素。

在制剂中还可使用粘着剂如羧甲基纤维素和粉末、颗粒或胶乳状的天然或合成聚合物，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。其它添加剂可以是矿物油和植物油。

可以使用着色剂如无机颜料，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 0.5-90%的活性化合物。

为了防治杂草，本发明的活性化合物本身或在其制剂中，还可以与已知的除草剂和/或改善与农作物相容性的物质(安全剂)的混合

物的形式使用，可以是最终的制剂或贮罐混合物的形式。另一种可能是与含有一种或多种已知除草剂和安全剂的除草剂的混合物。

对于这些混合物适合的是已知的除草剂，例如：

乙草胺、氟羧草醚(-钠盐)、苯草醚、甲草胺、枯杀达(-钠盐)、莠灭净、Amicarbazone、先甲草胺、磺氨黄隆、莎稗磷、黄草灵、莠去津、唑啶炔草、四唑黄隆、Beflubutamid、草除灵(-乙酯)、呋草黄、苄嘧磺隆(-甲酯)、灭草松、Benzfendizone、Benzobicyclon、吡草酮、新燕灵(-乙酯)、双丙氨酰膦、治草醚、双嘧苯甲酸(-钠盐)、溴丁酰草胺、杀草全、溴苯腈、丁草胺、Butafenacil(-allyl)、丁氧环酮、苏达灭、Cafenstrole、醚脞草、长杀草、氟酮唑草(-乙酯)、氯硝醚、灭草平、杀草敏、氯嘧黄隆(-乙酯)、草枯醚、氯磺隆、氯麦隆、Cinidon(-ethyl)、环庚草醚、醚磺隆、Clefoxydim、烯草酮、炔草酯(-炔丙酯)、异恶草酮、稗草胺、二氯吡啶酸、Clopyrasulfuron(-methyl)、唑嘧磺胺(-盐)、Cumyluron、草净津、Cybutryne、草灭特、环丙磺隆、噻草酮、Cyhalofop(-butyl)、2,4-D、2,4-DB、异苯敌草、燕麦敌、麦草畏、(高-)2,4-滴丙酸、氯甲草(-甲酯)、唑嘧磺胺、安塔(-乙酯)、野燕枯、吡氟草胺、二氯吡隆、丁噁隆、哌草丹、克草胺、戊草津、噻吩草胺、Dimexyflam、敌乐胺、草乃敌、敌草快、氟硫草定、敌草隆、香草隆、Epropodan、EPTC、禾草畏、丁氟消草、胺苯黄隆(-甲酯)、乙呋草黄、Ethoxyfen、乙氧嘧磺隆、Etobenzanid、(高-)噁唑禾草灵、Fentrazamide、氟燕灵(-异丙酯、-异丙酯-L、-甲酯)、啶嘧磺隆、氟鼠灵、(精-)吡氟禾草灵、Fluazolate、Flucarbazone(-sodium)、Flufenacet、氟唑啶草、酰亚胺苯氧乙酸(-戊酯)、氟噁嗪酮、Flumipropyn、氟唑啶草、氟草隆、氟咯草酮、乙羧氟草隆(-乙酯)、胺草唑、Flupropacil、氟啶磺隆(-甲酯、-钠盐)、抑草丁(-丁酯)、氟草同、氟草烟丁氧异丙酯、氟氯胺啶、调嘧醇、呋草酮、达草氟(-甲酯)、Fluthiamide、氟磺胺草醚、Foramsulfuron、草铵膦(-铵盐)、草甘膦(-异丙基铵)、氟硝磺酰胺、吡氟氯禾灵(-乙氧基乙酯、-P-甲酯)、六嗪同、咪草酸(-甲酯)、Imazamethapyr、咪草啶酸、Imazapic、灭草烟、灭草嗪、咪草烟、啶咪磺隆、Iodosulfuron(-methyl、-sodium)、碘苯腈、异乐灵、异丙隆、异恶隆、异恶草胺、Isoxachlortole、异恶氟草、恶草醚、乳

氟禾草灵、环草啞、利谷隆、2 甲 4 氯、2 甲 4 氯丙酸、苯噻草胺、Mesotrione、苯噻草、吡草胺、噻唑隆、色满隆、秀谷隆、异丙甲草胺、唑草磺胺、甲氧隆、赛可津、甲磺隆(-甲酯)、草达灭、绿谷隆、萘丙胺、草萘胺、草不隆、烟嘧磺隆、达草灭、坪草丹、黄草消、炔丙恶唑草、恶草灵、环丙氧磺隆、氯恶嗪草、乙氧氟草醚、百草枯、壬酸、胺硝草、Pendralin、Pentoxazone、甜菜宁、Picolinafen、哌草磷、丙草胺、氟嘧磺隆(-甲酯)、Proflumazone、扑草净、毒草胺、敌稗、噻草酸、异丙草胺、Propoxycarbazone(-sodium)、拿草特、苄草丹、氟丙磺隆、氟唑草酯(-乙酯)、Pyrazogyl、吡唑特、吡嘧黄隆(-乙酯)、苄草唑、嘧苯草肟、稗草畏、达草止、Pyridatol、Pyriftalid、肟啞草(-甲酯)、嘧硫苯甲酸(-钠)、二氯喹啉酸、喹草酸、灭藻醌、喹禾灵(精喹禾灵、精喹禾灵四氢糠基酯)、玉嘧磺隆、稀禾啞、西玛津、西草净、磺草酮、磺胺草唑、嘧磺隆(-甲酯)、草甘膦、乙黄磺隆、丙戊草胺、丁唑隆、Tepaloxymdim、特丁津、去草净、噻醚草胺、Thiaflumide、噻氟啞草、噻二唑胺、噻黄隆(-甲酯)、杀草丹、丁草威、肟草酮、野麦畏、醚苯磺隆、苯黄隆(-甲酯)、定草、灭草环、氟乐灵、Trifloxysulfuron、氟胺黄隆(-甲酯)、Tritosulfuron。

对于该混合物，还可以考虑其它已知的安全剂，例如

AD-67、BAS-145138、解草酮、喹氧乙酸(-异庚酯)、抑害腈、2,4-D、DKA-24、抑害胺、香草隆、解草啞、解草唑(-乙酯)、解草安、肟草安、解草唑、Isoxadifen(-ethyl)、MCPA、2 甲 4 氯丙酸(2 甲 4 氯丙酸钾)、吡咯二酸(-二乙酯)、MG-191、解草腈、PPG-1292、R-29148。

还可能是与其它已知活性化合物的混合物，其它活性化合物如杀真菌剂、杀昆虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、驱鸟剂、植物营养剂以及改善土壤结构的组合物。

所述活性化合物可以以其本身、其制剂的形式使用，或者由其通过稀释制备的使用形式来使用，例如，即用溶液、混悬液、乳液、粉末、糊或颗粒。它们以常规方式使用，例如，通过灌溉、喷雾、雾化或散播。

本发明的活性化合物可以在植物发出苗前也可以在出苗后使用。

也开在播种前掺入土壤中。

所述活性化合物的用量可以在较宽的范围内变化。这基本上依赖于所需作用的本质。一般来说，每公顷土壤面积用量为 1 g 至 10 kg 活性化合物，优选每公顷 5 g 至 5 kg。

本发明活性化合物具有强的杀微生物活性并且能在植物保护和材料保护中用于防治不希望的微生物，如真菌和细菌。

杀真菌剂在植物保护中用于防治 Plasmodiophoromycetes、卵菌纲 (Oomycetes)、Chytridiomycetes、接合菌纲 (Zygomycetes)、子囊菌纲 (Ascomycetes)、担子菌纲 (Basidiomycetes) 和 (半) 知菌纲 (Deuteromycetes)。

杀菌剂在植物保护中用于防治极毛杆菌科 (Pseudomonadaceae)、根瘤菌科 (Rhizobiaceae)、肠杆菌科 (Enterobacteriaceae)、棒状杆菌 (Corynebacteriaceae) 和链霉菌科 (Streptomycetaceae)。

举例性，但非限制性地提及几种落入上述上位概念的真菌或细菌性疾病的病原体：

黄单孢菌 (*Xanthomonas*)，例如野油菜黄单孢菌水稻致病变种 (*Xanthomonas campestris* pv. *Oryzae*)；

假单胞菌 (*Pseudomonas*)，例如丁香假单胞菌黄瓜致病变种 (*Pseudomonas syringae* pv. *Lachrymans*)；

欧文氏菌 (*Erwinia*)，例如解淀粉欧文氏菌 (*Erwinia amylovora*)；

腐霉 (*Pythium*)，例如终极腐霉 (*Pythium ultimum*)；

疫霉 (*Phytophthora*)，例如蔓延疫霉 (*Phytophthora infestans*)；

假霜霉 (*Pseudoperonospora*)，例如葎草假霜霉 (*Pseudoperonospora humuli*) 或古巴假霜霉 (*Pseudoperonospora cubensis*)；

单轴霉 (*Plasmopara*)，例如葡萄生单轴霉 (*Plasmopara viticola*)；

盘梗霉 (*Bremia*)，例如莴苣盘梗霉 (*Bremia lactucae*)；

霜霉 (*Peronospora*)，例如豌豆霜霉 (*Peronospora pisi*) 或芸苔

霜霉 (*P. Brassicae*);

白粉菌 (*Erysiphe*), 例如禾白粉菌 (*Erysiphe graminis*);

单丝壳菌 (*Sphaerotheca*), 例如苍耳单丝壳菌 (*Sphaerotheca fuliginea*);

柄球菌 (*Podosphaera*), 例如苹果白粉病柄球菌 (*Podosphaera leucotricha*);

黑星菌 (*Venturia*), 例如苹果黑星菌 (*Venturia inaequalis*);

核腔菌 (*Pyrenophora*), 例如圆核腔菌 (*Pyrenophora teres*) 或麦类核腔菌 (*P. Graminea*);

(分生孢子型 (*Konidienform*): *Drechslera*, 同: 长蠕孢属 (*Helminthosporium*));

旋孢霉 (*Cochliobolus*), 例如禾旋孢霉 (*Cochliobolus sativus*)

(分生孢子型: *Drechslera*, 同: 长蠕孢属);

单孢锈菌 (*Uromyces*), 例如疣顶单孢锈菌 (*Uromyces appendiculatus*);

柄锈菌 (*Puccinia*), 例如隐匿柄锈菌 (*Puccinia recondita*);

核盘菌 (*Sclerotinia*), 例如油菜核盘菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*);

腥黑粉菌 (*Tilletia*), 例如小麦网腥黑粉菌 (*Tilletia caries*);

黑粉菌 (*Ustilago*), 例如裸黑粉菌 (*Ustilago nuda*) 或燕麦黑粉菌 (*Ustilago avenae*);

薄膜革菌 (*Pellicularia*), 如佐佐木氏薄膜革菌 (*Pellicularia sasakii*);

Pyricularia-Arten, 如 *Pyricularia oryzae*;

镰孢菌 (*Fusarium*), 例如大刀镰孢 (*Fusarium culmorum*);

葡萄孢 (*Botrytis*), 例如灰色葡萄孢 (*Botrytis cinerea*);

壳针孢 (*Septoria*), 例如颖枯壳针孢 (*Septoria nodorum*);

小球腔菌 (*Leptosphaeria*), 如颖枯小球腔菌 (*Leptosphaeria nodorum*);

尾孢 (*Cercospora*), 例如 *Cercospora canescens*;

链格孢 (*Alternaria*), 例如甘蓝黑斑病链格孢 (*Alternaria brassicae*); 和

Pseudocercospora-Arten , 如 *Pseudocercospora herpotrichoides*。

本发明活性化合物在植物中也具有强的防御作用。因此, 他们适合于诱导植物本身对不希望的微生物攻击的防御功能。

在本发明中, 植物保护诱导物质(诱发抗性)是指能够刺激植物的防御系统的物质, 使被处理的植物在用不希望的微生物接种后对这些微生物基本上表现出抗性。

在本发明中不希望的微生物是指植物病原的真菌、细菌和病毒。本发明化合物也可用于在处理一定时间内保护植物免受上述病原体的侵袭。提供保护的时间一般为在用活性物质处理植物后 1 至 10 天, 优选 1 至 7 天。

在防治植物病害需要的浓度下, 本发明活性化合物良好的植物耐受性使其可用于处理植物的地上部分、植物繁殖材料和种子以及土壤。

本发明的活性化合物也适合用于提高农作物的产量。此外, 他们低毒性和具有良好的植物耐受性。

在一定浓度和用量下, 本发明的活性化合物也可任选用作除草剂, 以影响植物的生长, 以及用于防治有害动物。也可任选将他们用作合成其它活性化合物的中间体和前体。

在材料保护中, 本发明的活性物质可用于保护工业材料抵御不希望的微生物的侵袭和破坏。

本发明意义上的工业材料可以理解为在工厂中制造的供应用的无生命材料, 例如可用本发明活性化合物处理而免于由微生物引起的变化或破坏的工业材料可以是粘合剂、胶、纸和板、纺织材料、皮革、木材、涂料和塑料部件、冷却剂和其他可被微生物侵袭或破坏的材料。在要保护的材料中还可提及生产设备的部件, 例如可被微生物的繁殖影响的冷却水循环系统。本发明意义上的工业材料优选是指粘合剂、胶、纸和板、皮革、木材、涂料、冷润滑剂和导热液体, 特别优选木材。

可使工业材料降解或改变的微生物例如可提及细菌、真菌、酵母、藻类和淤泥(Schleim)微生物。本发明活性化合物优选用于防治真菌, 特别是霉菌、使木材变色和破坏木材的真菌(担子菌类)以及防治淤泥

微生物和藻类。

例如可提及下述属的微生物：

链格孢属(*Alternaria*)，如纤细链格孢(*Alternaria tenuis*)，
曲霉属(*Aspergillus*)，如黑曲霉(*Aspergillus niger*)，
毛壳属(*Chaetomium*)，如球毛壳霉(*Chaetomium globosum*)，
粉孢革菌属(*Coniophora*)，如单纯粉孢革菌(*Coniophora puetana*)，

香菇属(*Lentinus*)，如 *Lentinus tigrinus*，
青霉属(*Penicillium*)，如灰绿青霉(*Penicillium glaucum*)，
多孔菌属(*Polyporus*)，如变色多孔菌(*Polyporus versicolor*)，

短柄霉属(*Aureobasidium*)，如出芽短柄霉(*Aureobasidium pullulans*)，

Sclerophoma，如 *Sclerophoma pityophila*，
木霉属(*Trichoderma*)，如特德哈氏属(*Trichoderma viride*)，
埃希氏杆菌属(*Escherichia*)，如大肠杆菌(*Escherichia coli*)，

假单胞菌属(*Pseudomonas*)，如铜绿色极毛杆菌(*Pseudomonas aeruginosa*)，

葡萄球菌属(*Staphylococcus*)，如金黄色葡萄球菌(*Staphylococcus aureus*)。

根据其各自的物理和/或化学性能，可将所述活性化合物转化成常规制剂，如溶液剂、乳剂、混悬剂、粉剂、泡沫、糊剂、颗粒剂、气雾剂、聚合物包封的微囊和用于种子的包衣组合物以及 ULV-冷-和热雾化制剂。

这些制剂是以已知方法制备的，例如通过将活性化合物与增量剂，即液体溶剂、在压力下液化的气体和/或固体载体混合而生产，制剂中任选使用表面活性剂，即乳化剂和/或分散剂和/或发泡剂。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。适合的液体溶剂主要有：芳香烃类，如二甲苯、甲苯或烷基萘；氯代芳香烃类或氯代脂肪烃类，如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷；脂肪烃类，如环己烷或链烷烃，例如石油馏份；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。液化的气体增量剂或载体物质是指在常温常压下为气体的液体，例如气雾推进剂，如卤代烃类以及丁烷、丙烷、氮和二氧化碳。适合的固体载体有：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，以及合成的无机和有机粉末颗粒，以及有机材料的颗粒如锯末、坚果壳、玉米穗茎和烟草茎；适合的乳化剂和/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：例如木素亚硫酸废液和甲基纤维素。

在制剂中还可使用粘着剂如羧甲基纤维素和粉末、颗粒或胶乳状的天然或合成聚合物，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。其它添加剂可以是矿物油和植物油。

可以使用着色剂如无机颜料，例如氧化铁、二氧化钛和普鲁士兰，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0.5-90%的活性化合物。

本发明活性化合物也可以其本身或在其制剂中与已知的杀真菌剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂或杀虫剂混合应用，以例如拓宽活性谱或者避免产生抗性。由此，在很多情况下可以获得协同效应，即混合物的活性大于单个组分的活性。

作为混合组分例如可考虑如下化合物：

杀真菌剂：

2-苯基苯酚；8-羟基喹啉硫酸盐；噻二唑素-S-甲酯；Aldimorph；Amidoflumet；氯丙磷酸；氯丙磷酸钾；Andoprim；敌菌灵；戊环唑；腈嘧菌酯；苯霜灵；麦锈灵；苯菌灵；Benthiavalicarb-Tsopropyl；Benzamacril；苄烯酸；苄烯酸-异丁酯；双丙氨酰膦；乐杀螨；联苯；双苯三唑醇；灭瘟素；糠菌素；磺嘧菌灵；粉病定；丁基胺；石硫合

剂; Capsimycin; 敌菌丹; 克菌丹; 多菌灵; 萎锈灵; Carpropamid; Carvon; 灭螨锰; 灭瘟唑; 苯咪唑菌; 地茂散; 百菌清; 乙菌利; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; 清菌脲; 环唑醇; 环丙嘧啶; 酯菌胺; Dagger G; 双乙氧咪唑威; Dichlofluanid; Dichlone; 双氯酚; Diclocymet; 哒菌清; 氯硝胺; 乙霉威; 噁醚唑; Diflumetorim; 甲菌定; 烯酰吗啉; Dimoxystrobin; 烯唑醇; 烯唑醇-M; 敌螨普; 二苯胺; 吡菌硫; 灭菌磷; 二噻农; 多果定; 敌菌酮; 克瘟散; 氧唑菌; Ethaboxam; 乙菌定; 氯唑灵; 噁唑酮菌; Fenamidone; 菌拿灵; 异噻菌醇; 腈苯唑; 呋菌胺; Fenhexamid; 种衣酯; Fenoxanil; 拌种咯; 苯锈定; 丁苯吗啉; 福美铁; 氟定胺; Flubenzimine; Fludioxonil; 氟联苯菌 (Flumetover); Flumorph; 氟菌安; Fluoxastrobin; 喹唑菌酮; 调噻醇; 氟硅唑, 磺菌胺; 氟酰胺; 粉唑胺; 灭菌丹; 藻菌磷 (Fosetyl-Aluminium); 藻菌磷 (Fosetyl-Natrium); 麦穗宁; 呋氧丙灵; 呋吡唑灵; 灭菌安 (Furcarbonil); 拌种胺; 双胍盐; 六氯苯; 己唑醇; 噁霉灵; 烯菌灵; 酰胺唑; 双胍辛 (Iminoctadine) 三乙酸盐; 双胍辛三对十二烷基苯磺酸盐 (Iminoctadine trisalbesil); Iodocarb; 环戊唑醇; 异稻瘟脲; 异丙定; Iprovalicarb; Irumamycin; 富士一号; 氯苯咪菌酮; 春雷霉素; 亚胺菌; 锰铜混剂; 代森锰锌; 代森锰; Meferimzone; 噻菌胺; 丙氧灭锈胺; 甲霜灵; 甲霜灵-M; 环戊唑菌; 磺菌威; 甲呋菌胺; 代森联; 叉氧苯酰胺; 噻菌胺; 米多霉素; 腈菌唑; 甲菌利; 多马霉素; Nicobifen; 异丙消; Noviflumuron; 氟苯嘧啶醇; 甲呋酰胺; Orysastrobin; 噁霜灵; 喹菌酮; Oxpoconazole; 氧化萎锈灵 (Oxycarboxin); Oxyfenthiin: 多效唑; 稻瘟酯; 戊菌唑; 戊菌隆; 双氯苯磷; 四氯苯酞; 多马霉素; Picoxystrobin; 多氧霉素; Polyoxins; 噻菌灵; 丙氧灵; 杀菌利; 百维灵; Propanosine-sodium; 丙环唑; 甲基代森锌; Proquinazid; Prothioconazole; Pyraclostrobin; 定菌磷; 啉斑脲; 二甲噻菌胺; 咯喹酮; 氯吡呋醚, Pyrrolnitrine; 唑喹菌酮; 喹氧灵; 五氯硝基苯; Simeconazole; 螺噁茂胺; 硫; 戊唑醇; 叶枯酞; 四氯硝基苯; 调环烯; 氟醚唑; 涕必灵; 噻菌脲; 溴氧唑菌; 甲基托布津; 福美双; 硫氟苯甲酰胺; 甲基立枯磷; 对甲抑菌灵; 三唑酮; 菌唑醇; 叶锈特; 唑菌素; 杨菌胺;

三环唑; 克啉菌; Trifloxystrobin; 氟菌唑; 噻氧灵; 戊叉唑菌; 烯效唑; 有效霉素; 烯菌酮; 代森锌; 福美锌; Zoxamide; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔基]氧基]-3-甲氧基苯基]乙基]-3-甲基-2-[(甲基磺酰基)氨基]-丁酰胺; 1-(1-萘基)-1H-吡咯-2,5-二酮; 2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺酰基)-吡啶; 2-氨基-4-甲基-N-苯基-5-噻唑甲酰胺; 2-氯-N-(2,3-二氢-1,1,3-三甲基-1H-茛-4-基)-3-吡啶甲酰胺; 3,4,5-三氯-2,6-吡啶二腈; Actinovate; 顺式-1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-环庚醇; 1-(2,3-二氢-2,2-二甲基-1H-茛-1-基)-1H-咪唑-5-甲酸甲酯; 碳酸一钾(monopotassium carbonate); N-(6-甲氧基-3-吡啶基)-环丙烷甲酰胺; N-丁基-8-(1,1-二甲基乙基)-1-氧杂螺[4.5]癸烷-3-胺; 四硫钠(Sodium tetrathiocarbonate); 以及铜盐和铜盐制剂, 如波尔多液; 铜的氢氧化物; 环烷酸铜; 王铜(Copper oxychloride); 硫酸铜; 硫杂灵; 氧化亚铜; Mancopper; 喹啉铜。

杀菌剂:

溴硝丙二醇、双氯酚、氯定、福美镍、春雷霉素、异噻菌酮、咪喃甲酸、土霉素、噻菌灵、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、ABG-9008、啉虫脒、灭螨醌, 氟丙菊酯、Acetoprole、棉铃威、AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, 棉铃威、涕灭威、灭虱威、丙烯除虫菊、丙烯除虫菊 1R-异构体, 甲体氯氰菊酯(Alphacypermethrin)、Amidoflumet, 灭害威, 双甲脒、齐墩螨素、AZ-60541、艾扎丁、甲基吡啶磷、甲基谷硫磷、乙基谷硫磷、三唑锡,

波林杆菌芽孢、Bacillus sphaericus、柯敌克菌、苏金杆菌、苏金杆菌菌株 EG-2348、苏金杆菌菌株 GC-91、苏金杆菌菌株 NCTC-11821、Baculoviren、Beauveria bassiana、Beauveria tenella、噁虫威、丙硫克百威、杀虫磺、苯螨特、 β -氟氯氰菊酯、乙体氯氰菊酯、联苯腈酯、联苯菊酯、乐杀螨、反丙烯除虫菊、反丙烯除虫菊-S-环戊基-异构体、Bioethanomethrin、生物氯菊酯、右旋反灭虫菊酯, Bistrifluron、BPMC、Brofenprox、乙基溴硫磷、溴螨酯、溴苯烯磷(-甲酯)、BTG-504、BTG-505、合杀威、噻嗪酮、特密硫磷、丁酮威、氧丁叉威、丁基吡啶灵(Butylpyridaben)、

硫线磷、毒杀芬、甲萘威、克百威、三硫磷、丁硫克百威、杀螟丹、CGA-50439、灭螨猛、氯丹、杀虫脒、Chloethocarb、氯氧磷、氟唑虫清、毒虫畏、氟啶脲、氯甲硫磷、乙酯杀螨醇、氯化苦、Chlorproxyfen、甲基毒死蜱、毒死蜱(-乙酯)、Chlovaporthrin、Chromafenozide、Cis-Cypermethrin、顺式灭虫菊(Cis-Resmethrin)、Cis-Permethrin、Cloocythrin、除线威、四螨嗪、Clothianidin、Clothiazoben、十二碳二烯醇、蝇毒磷、苯腈磷、杀螟腈、Cycloprene、乙氧菊酯、Cydia pomonella、氟氯菊酯、氯氟菊酯、三环锡、氯菊酯、苯醚菊酯(1R-反式-异构体)、灭蝇胺、

DDT、溴氧菊酯、甲基内吸磷、磺吸磷、丁醚脲、氯亚磷、二嗪磷、除线磷、敌敌畏、氟脲杀、百治磷、Dicyclanil、开乐散、乐果、甲基毒虫畏、敌螨通、敌螨普、Dinotefuran、苯虫醚、乙拌磷、碘酰丁二辛、苯氧炔螨、DOWCO-439

Eflusilanate、Emamectin、Emamectin-benzoate、右旋烯炔菊酯(1R-异构体)、硫丹、Entomopftora spp.、EPN、高氧戊菊酯、苯虫威、Ethiprole、乙硫磷、灭克磷、醚菊酯、特苯噁唑、氧嘧啶磷、

氧磺磷、克线磷、喹螨醚、杀螨锡、五氟苯菊酯、杀螟硫磷、丁苯威、苯硫威、Fenoxacrim、双氧威、甲氧菊酯、Fenpyrad、Fenpyrithrin、唑螨酯、丰索磷、倍硫磷、氟硝二苯胺、杀灭菊酯、锐劲特、Flonicamid、Fluacrypyrim、氟啶蜱脲、噻唑螨、Flubrocycythrinate、氟蜱脲、氟氧戊菊酯、Flufenerim、氟虫脲、氟丙苄醚、氟氯苯菊酯、Flupyrzofos、Flutenzin(氟螨嗪)、氟胺氧菊酯、地虫磷、伐虫醚、安果、丁苯硫磷、噻唑酮磷、Fubfenprox(Fluproxyfen)、呋线威、

林丹、诱虫十六酯、诱杀烯混剂、颗粒层增殖病毒、

卤醚菊酯、特丁苯酰肼、HCH、HCN-801、庚虫磷、氟铃脲、噻螨酮、灭蚁腴、烯虫乙酯、

IKA-2002、吡虫啉、咪炔菊酯、噁二唑虫、碘硫磷、异稻瘟净、氯唑磷、丙胺磷、异丙威、异噁唑磷、齐墩螨素、

Japonilure、

噻噁菊酯、核多角体病毒、蒙七七七、

氯氟氰菊酯、林丹、氯丙氧脲,

马拉硫磷、灭蚜磷、甲亚砷磷、四聚乙醛、威百亩、虫螨畏、甲胺磷、*Metharhizium anisopliae*、*Metharhizium flavoviride*、杀扑磷、灭虫威、灭多虫、蒙五一五、Methoxychlor、甲氧苯酰肼、速灭威、噁虫酮、速灭磷、米尔螨素、Milbemyein、MKI-245、MON-45700、久效磷、Moxidectin、MTI-800,

二溴磷、NC-104、NC-170、NC-184、NC-194、NC-196、贝螺杀、烟碱、硝胺烯啶、硝虫噻嗪、NNI-0001、NNI-0101、NNI-0250、NNI-9768、双苯氟脲、Noviflumuron,

OK-5101、OK-5201、OK-9601、OK-9602、OK-9701、OK-9802、氧乐果、甲胺叉威、砒吸磷,

Paecilomyces fumosoroseus、甲基对硫磷、对硫磷(-乙酯)、氯菊酯(顺式-,反式-)、石油、PH-6045、苯醚菊酯(1R-反式异构体)、稻丰散、甲拌磷、伏杀磷、亚胺硫磷、磷胺、乙丙磷威、辛硫磷、增效醚、抗蚜威、虫螨磷A、甲基虫螨磷、炔酮菊酯、丙溴磷、克螨特、丙虫磷、猛杀威、烯虫磷、残杀威、丙硫磷、发果、Protrifenbute、拒嗪酮、吡唑硫磷、反灭虫菊、除虫菊、哒螨酮、哒螨酮、Pyridalyl、pyridathion、噻胺苯醚、蚊蝇醚,

喹噁磷,

灭虫菊、RH-5849、Ribavirin、RU-12457、RU-15525,

S-421、S-1833、杀抗松、硫线磷、SI-0009、灭虫硅醚、艾克敌、Spirodiclofen、Spiromesifen、氟虫胺、治螟磷、乙丙硫磷、SZI-121,

氟胺氰菊酯、双苯酰肼、吡螨胺、噻丙磷(Tebupirimifos)、氟虫隆、七氟菊酯、双硫磷、灭虫威、Terbam、特丁磷、杀虫威、三氯杀螨砒、胺菊酯、胺菊酯(1R-异构体)、Tetrasul、辛体氯氟菊酯、噻虫啉(Thiacloprid)、Thiamethoxam、蛾蝇腈、Thiatriphos、硫环杀、硫双威、久效威、甲基乙拌磷、杀虫双、敌贝特、Tolfenpyrad、溴氯氟菊酯、四溴菊酯、Transfluthrin、苯螨噻、唑蚜威、三唑磷、Triazuron、Trichlophenidine、敌百虫、杀虫隆、混杀威,

蚜灭多、氟吡唑虫、Verbutin、麦柯特,尔,

WL-108477、WL-40027、

YI-5201、YI-5301、YI-5302、

XMC、灭杀威、

ZA-3274、Zeta-cypermethrin、Zolaprofos、ZXI-8901、

化合物 3-甲基-苯基-丙基氨基甲酸酯(速灭威 Z)、

化合物 3-(5-氯-3-吡啶基)-8-(2,2,2-三氟乙基)-8-氮杂二环[3.2.1]-辛烷-3-腈(CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3)和相应的 3-内-异构体(CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5)(参见 WO-96/37494、WO-98/25923),

以及含有杀虫有效的植物提取物、线虫、真菌或病毒的制剂。

与其它已知活性化合物例如除草剂或与肥料以及生长调节剂的混合物也是可能的。

此外,本发明式(I)化合物也具有很好的抗霉菌的活性。它们具有很宽的抗霉菌活性谱,特别是抗皮肤病菌(Dermatophyten)和酵母菌(Sproßpilze)、霉菌和双相性的真菌(例如抗念珠菌属(Candida-Spezies)如白色念珠菌(Candida albicans)、Candida glabrata)以及如絮状表皮癣菌(Epidermophyton floccosum)、曲霉(Aspergillus)属如黑曲霉(Aspergillus niger)和烟曲霉(Aspergillus fumigatus)、发癣菌(Trichophyton)属如须发癣菌(Trichophyton mentagrophytes)、小孢子菌(Microsporon)属如犬小孢子菌(Microsporon canis)和头癣小孢子菌(audouinii)。这些霉菌的列举决不是对本发明抗霉菌谱的限制,而只是为了说明。

本发明活性化合物也可以其本身、以其制剂或由其制备的应用形式如即用型溶液、混悬液、可湿性粉剂、糊剂、可溶性粉剂、粉剂和颗粒剂应用。所述应用可按常规方式进行,例如通过浇泼、喷雾、雾化、播撒、撒粉、泡沫、刮涂等。此外,也可以按照超低体积法施用活性化合物或者将活性化合物制剂或活性化合物本身喷注到土壤里。也可处理植物的种子。

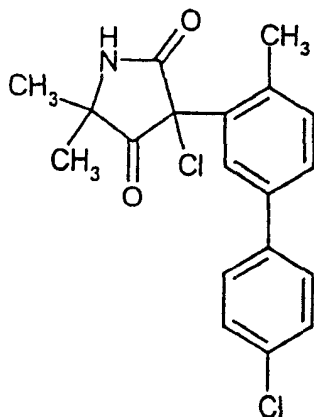
在作为杀真菌剂应用本发明活性化合物时,根据应用类型,其用量可在较大范围内变化。在处理植物部分时,活性化合物的用量一般为 0.1 至 10,000 g/ha,优选为 10 至 1,000 g/ha。在处理种子时,活性化合物的用量一般为每千克种子 0.001 至 50 g,优选为每千克种子 0.01 至 10 g。在处理土壤时,活性化合物的用量一般为 0.1 至 10,000

g/ha, 优选为 1 至 5,000 g/ha.

通过下述实施例说明本发明活性化合物的制备和应用。

制备实施例

实施例编号 I-1-1

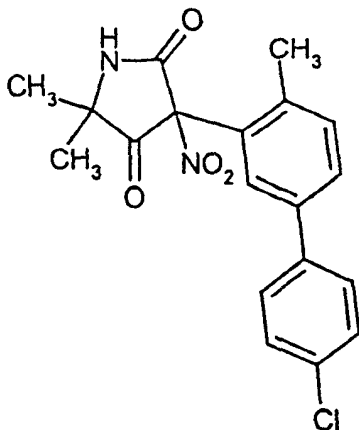


在 0-5℃下, 向在 30 ml 无水氯仿中的 0.98 g 实施例 I-1-a-18 (WO 99/48869) 中滴加在 1 ml 无水氯仿中的 0.24 ml 磺酰氯。30 分钟后反应完成(薄层色谱检测)。

用 NaHCO₃-溶液洗涤反应混合物, 干燥有机相并蒸出溶剂。

收率: 0.85 g (理论量的 78%), 熔点 175℃。

实施例编号 I-1-29

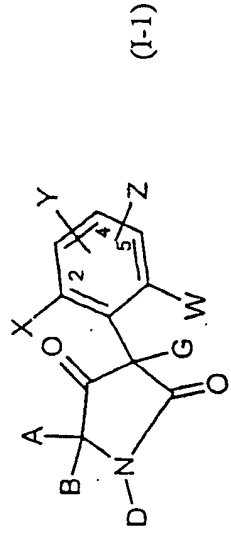


在室温下，向在 45 ml 无水氯仿中的 0.98 g 实施例 I-1-a-18 (W0 99/48869) 中滴加 0.33g (5.2 mmol) 发烟硝酸。30 分钟后反应完成(薄层色谱检测)。

将反应混合物加到 40ml 冰水中，分出有机相，用二氯甲烷萃取水相并干燥合并的有机相，然后蒸出溶剂。用硅胶柱色谱进行纯化(二氯甲烷，乙酸乙酯，10:1)

收率：0.75 g (理论量的 67%)，熔点 157℃。

类似于实施例(I-1-1)并按照制备的一般说明得到下述式(I-1)化合物

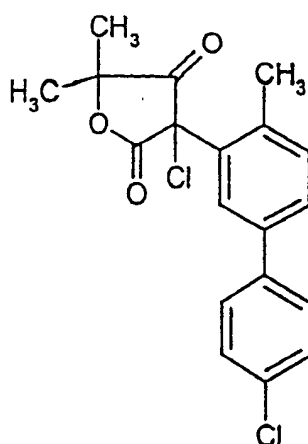


表A

实施例编号	W	X	Y	Z	D	G	A	B	熔点 °C
I-1-2	H	Cl	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	CH ₃	CH ₃	173
I-1-3	H	CH ₃	5-(3-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	CH ₃	CH ₃	188
I-1-4	CH ₃	CH ₃	4-(3-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ (CH ₂) ₂ -		165
I-1-5	CH ₃	CH ₃	4-(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)	H	H	Cl	(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ (CH ₂) ₂ -		281
I-1-6	H	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	4-CH ₃	H	Cl	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		208
I-1-7	H	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	4-CH ₃	H	Cl	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		204
I-1-8	Cl	CH ₃	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		324
I-1-9	Cl	CH ₃	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		291
I-1-10	CH ₃	C ₂ H ₅	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		258
I-1-11	H	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	i-C ₃ H ₇	CH ₃	192

续表 A

实施例编号	W	X	Y	Z	D	G	A	B	熔点 °C
I-1-12	H	Cl	5-(3-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		228
I-1-13	H	CH ₃	5-(3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	H	H	Cl	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		203
I-1-14	H	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		218
I-1-15	H	CH ₃	5-(3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	H	H	Cl	CH ₃	CH ₃	222
I-1-16	H	Cl	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		250
I-1-17	H	Cl	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	-(CH ₂) ₂ -CHi-C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -		276
I-1-18	H	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	-(CH ₂) ₂ -CHn-C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -		223
I-1-19	H	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	-(CH ₂) ₂ -CHi-C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂		245
I-1-20	H	Cl	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	-(CH ₂) ₄ -		227
I-1-21	H	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	-(CH ₂) ₂ -		219
I-1-22	H	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₃ -		227
I-1-23	H	Cl	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₃ -		286
I-1-24	H	Cl	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	-(CH ₂) ₅ -		269
I-1-25	H	Cl	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	-(CH ₂) ₂ -CHn-C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -		255
I-1-26	H	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	-(CH ₂) ₅ -		228
I-1-27	H	Cl	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		290
I-1-28	H	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	Cl	-(CH ₂) ₄ -		289
I-1-29	H	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	NO ₂	CH ₃	CH ₃	157

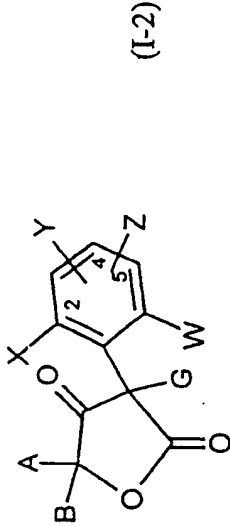
实施例 I-2-1

在冰冷却下，向 0.4 g 3-[2-甲基-5-(4-氯苯基)-苯基]-5,5-二甲基-4-羟基- Δ^3 -呋喃-2-酮的 10 ml 无水氯仿溶液中滴加磺酰氯 (0.164 g) 在 10 ml 无水氯仿中的溶液并在冰冷却下搅拌 30 分钟。

然后用水、饱和的碳酸氢钠溶液和饱和的氯化钠溶液洗涤反应混合物并干燥。

收率：0.4 g (理论量的 72%)，logP (pH 2.5) 4.8。

类似于实施例(I-2-1)并按照制备的一般说明得到下述式(I-2)化合物



表B

实施例编号	W	X	Y	Z	G	A	B	熔点 °C
I-2-2	H	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	Cl	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂		144-146
I-2-3	H	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	Cl	-(CH ₂) ₅ -		150
I-2-4	H	CH ₃	5-(3-Cl-C ₆ H ₄)	H	Cl	-(CH ₂) ₂ -CHCF ₃ -(CH ₂) ₂ -		108-110
I-2-5	H	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	Cl	i-C ₃ H ₇	CH ₃	logP 5.61
I-2-6	H	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	4-CH ₃	Cl	-(CH ₂) ₄ -		logP 5.56
I-2-7	H	C ₂ H ₅	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	Cl	CH ₃	CH ₃	logP 5.05
I-2-8	H	CH ₃	5-(4-CN-C ₆ H ₄)	H	Cl	CH ₃	CH ₃	198
I-2-9	H	CH ₃	5-(4-CN-C ₆ H ₄)	H	Cl	-(CH ₂) ₄ -		196
I-2-10	H	CH ₃	5-(4-F-C ₆ H ₄)	H	Cl	CH ₃	CH ₃	133-135
I-2-11	H	CH ₃	5-(3-F-C ₆ H ₄)	H	Cl	CH ₃	CH ₃	log P 4.30

续表B

实施例编号	W	X	Y	Z	G	A	B	熔点 °C
I-2-12	CH ₃	CH ₃	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	Cl	-(CH ₂) ₅ -		262
I-2-13	CH ₃	C ₂ H ₅	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	Cl	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		log P 5.59
I-2-14	CH ₃	CH ₃	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	Cl	CH ₃	CH ₃	log P 5.11
I-2-15	CH ₃	CH ₃	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	Cl	-(CH ₂) ₄ -		152-155
I-2-16	CH ₃	CH ₃	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	Cl	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		85-88
I-2-17	CH ₃	CH ₃	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	Cl	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		log P 4.91
I-2-18	CH ₃	CH ₃	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	Cl	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		178-180

logP 测定在 pH=2.3 下进行

给出的 LogP-值的测定是按照 EEC-Directive 79/831 附件 V. A8 通过 HPLC (高效液相色谱) 在反相柱 (C 18) 上测得的。温度: 43℃。

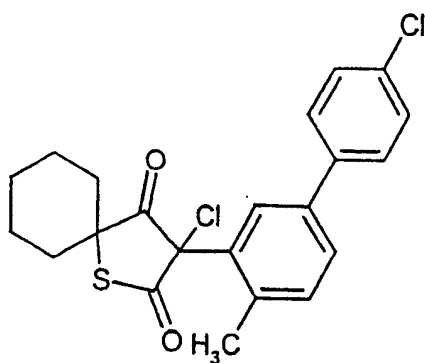
(a) 用于在酸性范围测定的流动相: 0.1% 磷酸水溶液和乙腈; 线性梯度从 10% 乙腈→90% 乙腈。

(b) 用于在中性范围测定的流动相: 0.01M 磷酸水缓冲溶液和乙腈; 线性梯度从 10% 乙腈→90% 乙腈。

用 logP-值已知的未支化的链烷-2-酮 (具有 3 - 16 个碳原子) 进行校正 (根据保留时间测定 logP-值, 通过两个连续的链烷酮的线性外推得到)。

$\lambda_{\max}$ -值借助于 200 nm - 400 nm 的 UV-光谱, 确定色谱信号的最大值。

实施例 I-3-1



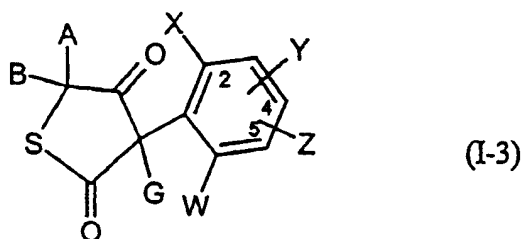
在冰冷却下, 向在 10 ml 无水氯仿中的 0.385 g 实施例 I-3-a-1 (WO 99/48869) 中滴加在 0.5 ml 无水氯仿中的 0.10 ml 磺酰氯并搅拌 20 分钟。

用 NaHCO_3 -溶液洗涤反应混合物, 干燥有机相并蒸出溶剂。为了进一步纯化, 将该产物在环己烷/乙酸乙酯中搅拌多次。

收率: 0.315 g (理论量的 75%), 熔点 157-160℃。

表 C

类似于实施例(I-3-1)并按照制备的一般说明得到下述式(I-3)化合物



实施例编号	W	X	Y	Z	G	A	B	熔点 °C
I-3-2	H	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	4-CH ₃	Cl	-(CH ₂) ₅ -		蜡状物

实施例 A

瘤额蚜 (Myzus) - 试验

溶剂: 7 重量份二甲基甲酰胺

乳化剂: 2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

为制备合适的活性化合物制剂, 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。

将被桃蚜虫 (桃瘤额蚜 (Myzus persicae)) 严重侵袭的甘蓝 (Brassica oleracea) 通过浸入希望浓度的活性化合物制剂中进行处理。

在规定时间后测定用 % 表示的杀死率。其中 100 % 表示所有蚜虫都被杀死; 0 % 表示没有蚜虫被杀死。

在该试验中, 例如下述制备实施例的化合物显示出良好活性:

表 A

损害植物的昆虫

桃蚜试验

活性化合物	活性化合物的 浓度, ppm	6天后的杀死率, %
实施例 I-1-1	500	95
实施例 I-1-14	500	100
实施例 I-1-6	500	98
实施例 I-1-7	500	100
实施例 I-1-9	500	95
实施例 I-1-13	500	100
实施例 I-1-15	500	95

实施例 B

猿叶甲 (Phaedon)-幼虫试验

溶剂: 7 重量份二甲基甲酰胺

乳化剂: 2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

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。

通过将甘蓝 (*Brassica oleracea*) 浸入所需浓度的活性化合物制剂中进行处理并在叶子仍然潮湿时放上辣根猿叶甲虫 (*Phaedon cochleariae*) 的幼虫。

在规定时间后测定用 % 表示的杀死率。其中 100 % 表示所有甲虫幼虫都被杀死; 0 % 表示没有甲虫幼虫被杀死。

在该试验中, 例如下述制备实施例的化合物显示出良好活性:

表 B
损害植物的昆虫
猿叶甲幼虫试验

活性化合物	活性化合物的浓度, ppm	7天后的杀死率, %
实施例 I-2-1	1000	100
实施例 I-1-2	500	100
实施例 I-1-1	500	100
实施例 I-1-3	500	100
实施例 I-1-14	500	100
实施例 I-1-6	500	100
实施例 I-1-7	500	100
实施例 I-1-9	500	100
实施例 I-1-11	500	100
实施例 I-1-12	500	100
实施例 I-1-13	500	100
实施例 I-1-15	500	100
实施例 I-3-1	500	100

实施例 C

菜蛾 (Plutella)-试验

溶剂: 7 重量份二甲基甲酰胺

乳化剂: 2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

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。

通过将甘蓝 (*Brassica oleracea*) 浸入所需浓度的活性化合物制剂中进行处理并在叶子仍然潮湿时放上菜蛾 (*Plutella xylostella*)

的幼虫。

在规定时间内测定用 % 表示的杀死率。其中 100 % 表示所有幼虫都被杀死；0 % 表示没有幼虫被杀死。

在该试验中，例如下述制备实施例的化合物显示出良好活性：

表 C
损害植物的昆虫
菜蛾试验

活性化合物	活性化合物的浓度, ppm	7天后的杀死率, %
实施例 I-1-11	500	100
实施例 I-1-12	500	100
实施例 I-1-13	500	100
实施例 I-1-15	500	100

实施例 D

覃蝇 (*Spodoptera exigua*) - 试验

溶剂： 7 重量份二甲基甲酰胺

乳化剂： 2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

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。

通过将甘蓝 (*Brassica oleracea*) 浸入所需浓度的活性化合物制剂中进行处理并在叶子仍然潮湿时放上覃蝇 (*Spodoptera exigua*) 的毛虫。

在规定时间内测定用 % 表示的杀死率。其中 100 % 表示所有毛虫都被杀死；0 % 表示没有毛虫被杀死。

在该试验中，例如下述制备实施例的化合物显示出良好活性：

表 D
损害植物的昆虫
覃蝇试验

活性化合物	活性化合物的浓度, ppm	7天后的杀死率, %
实施例 I-1-11	500	90
实施例 I-1-13	500	100
实施例 I-1-15	500	100

实施例 E

草地贪夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*)-试验

溶剂: 7 重量份二甲基甲酰胺

乳化剂: 2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

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。

通过将甘蓝 (*Brassica oleracea*) 浸入所需浓度的活性化合物制剂中进行处理并在叶子仍然潮湿时放上草地贪夜蛾的毛虫。

在规定时间内测定用 % 表示的杀死率。其中 100% 表示所有毛虫都被杀死; 0% 表示没有毛虫被杀死。

在该试验中, 例如下述制备实施例的化合物显示出良好活性:

表 E
损害植物的昆虫

活性化合物	活性化合物的浓度, ppm	7天后的杀死率, %
实施例 I-2-1	1000	100
实施例 I-1-2	500	100
实施例 I-1-1	500	100
实施例 I-1-14	500	100
实施例 I-1-6	500	100
实施例 I-1-7	500	100
实施例 I-1-11	500	100
实施例 I-1-12	500	100
实施例 I-1-13	500	100
实施例 I-1-15	500	100

实施例 F

红叶螨 (*Tetranychus*) - 试验 (OP-抗性/浸入处理)

溶剂: 7 重量份二甲基甲酰胺

乳化剂: 2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

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。

将被各个发育期的棉叶螨 (*Tetranychus urticae*) 严重侵袭的豆类植物 (*Phaseolus vulgaris*) 浸入所需浓度的活性化合物制剂中进行处理。

在规定时间后测定用 % 表示的效果。其中 100 % 表示所有棉叶螨都被杀死; 0 % 表示没有棉叶螨被杀死。

在该试验中, 例如下述制备实施例的化合物显示出良好活性:

表 F
损害植物的昆虫
红叶螨试验 (OP-抗性/浸入处理)

活性化合物	活性化合物的浓度, ppm	7天后的杀死率, %
实施例 I-2-1	100	98
实施例 I-1-2	100	100
实施例 I-1-1	100	100
实施例 I-1-14	100	99
实施例 I-1-6	100	99
实施例 I-1-7	100	98
实施例 I-1-8	100	98
实施例 I-1-11	100	99
实施例 I-1-12	100	100
实施例 I-1-13	100	95
实施例 I-1-15	100	99

实施例 G

体外试验, 测定在微生物中的 ED_{50}

在微滴定板的凹坑中移入加有乳化剂 PS16 的待测活性化合物的甲醇溶液, 蒸发溶剂后, 向每一凹坑中加入 $200\mu\text{l}$ 土豆-葡萄糖-介质。

事先已将该介质与合适浓度的待测菌的孢子或菌丝混合。

所得的活性化合物的浓度为 0.1、1、10 和 100 ppm。所得乳化剂浓度为 300 ppm。

然后, 将微孔板在振荡器上于 22°C 温度下培养 3-5 天, 直至发现未处理的对照充分生长。

在波长为 620 nm 下进行光学评价, 由不同浓度的测量数据计算与未处理的对照相比, 活性化合物抑制真菌生长 50% 的剂量 (ED_{50})。

表 G
体外试验，测定在微生物中的 ED₅₀

活性化合物	微生物	ED ₅₀ -值
实施例 I-3-1	灰色葡萄孢	< 0.10
	<i>Pyricularia oryzae</i>	< 0.10
	小麦壳针孢	0.61
	燕麦黑粉菌	0.27

实施例 H

出苗后-试验

溶剂：5 重量份丙酮

乳化剂：1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

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混合，加入上述量的乳化剂，并用水稀释浓缩物至所需浓度。

用活性化合物制剂喷洒高度为 5-15 厘米高的测试植物，使其达到各希望的每单位面积活性化合物的量。如此选择喷洒液的浓度，使按 1000 l 水/ha 施用达到各希望的活性化合物的量。

3 周后记录植物受损害的程度，用相对于未处理的对照发育的 % 表示。

对此，0% = 无作用（如同未处理的对照）

100% = 完全毁掉

实施例 I

出苗前-试验

溶剂：5 重量份丙酮

乳化剂：1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

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混合，加入上述量的乳化剂，并用水稀释浓缩物至所需浓度。

将测试植物的种子播种到正常土壤中，约 24 小时后用活性化合物制剂喷洒土壤，使其达到各希望的每单位面积活性化合物的量。如此选择喷洒液的浓度，使施用 1000 l 水/ha 达到各希望的活性化合物的量。

3 周后记录植物受损害的程度，用相对于未处理的对照发育的 % 表

示。

对此, 0% = 无作用 (如未处理的对照)

100% = 完全毁掉

出苗前/温室	g ai/ha	看麦娘属	野燕麦	稗属	狗尾草属	苋属
实施例 I-1-4	250	95	90	100	100	90

出苗后/温室	g ai/ha	甜菜	看麦娘属	野燕麦	稗属	狗尾草属
实施例 I-1-14	250	0	80	100	100	100
实施例 I-1-11	250	0	95	90	100	100

出苗后/温室	g ai/ha	看麦娘属	野燕麦	稗属	狗尾草属
实施例 I-1-7	250	90	95	100	100
实施例 I-1-9	250	95	100	100	100
实施例 I-1-13	250	95	90	100	90

出苗后/温室	g ai/ha	甜菜	看麦娘属	野燕麦	马唐属	稗属	狗尾草属
实施例 I-1-2	125	0	90	95	100	100	90
实施例 I-1-1	125	0	95	100	90	100	100

出苗后/温室	g ai/ha	看麦娘属	野燕麦	稗属	狗尾草属	苋属	白芥属
实施例 I-1-6	250	70	100	100	95	70	-
实施例 I-1-8	250	95	95	100	100	70	80
实施例 I-1-10	250	100	100	100	100	80	80
实施例 I-1-4	250	100	100	100	100	-	70

实施例 J

单轴霉-试验(葡萄植物)/保护

溶剂: 24.5 重量份丙酮

24.5 重量份二甲基乙酰胺

乳化剂: 1.0 重量份烷基-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，并用水稀释浓缩物至所需浓度。

为了测定保护作用，用活性化合物制剂按照给定用量喷洒葡萄植物幼苗。在喷洒液干燥后，用葡萄生单轴霉(*Plasmopara viticola*)的孢子水悬浮液对植物进行接种，并在 20℃ 和相对空气湿度约 100% 的接种室中放置 1 天。然后将所述植物放在约 21℃ 和相对空气湿度约 90% 的温室中 4 天。使植物湿润并在接种室中放置 1 天。

接种 6 天后进行评价。其中 0% 表示与对照相当的活性水平，而 100% 表示没有观察到侵袭的活性水平。

表 J
单轴霉-试验(葡萄植物)/保护

活性化合物	活性化合物用量, g/ha	% 活性水平
实施例 I-1-2	100	100
实施例 I-1-1	100	100
实施例 I-1-14	100	100
实施例 I-1-6	100	94
实施例 I-1-11	100	100
实施例 I-1-12	100	94
实施例 I-1-13	100	94

实施例 K

黑星菌(*Venturia*)-试验(苹果)/保护

溶剂: 24.5 重量份丙酮

24.5 重量份二甲基乙酰胺

乳化剂: 1.0 重量份烷基-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，并用水稀释浓缩物至所需浓度。

为了测定保护作用，用活性化合物制剂按照给定用量喷洒植物幼苗。在喷洒液干燥后，用苹果痂病原体(*schorfferregers*)苹果黑星菌(*Venturia inaequalis*)分生孢子的水悬浮液接种植物，然后在接种室中于 20℃ 和 100% 相对空气湿度下放置 1 天。

将所述植物放在约 21℃ 和相对空气湿度约 90% 的温室中。

接种 10 天后进行评价。其中 0%表示与对照相当的活性水平，而 100%表示没有观察到侵袭的活性水平。

表 K
黑星菌-试验(苹果)/保护

活性化合物	活性化合物用量, g/ha	% 活性水平
实施例 I-1-2	100	96
实施例 I-1-1	100	97
实施例 I-1-6	100	99
实施例 I-1-11	100	100

实施例 L

临界浓度试验/土壤昆虫 - 处理转基因植物

测试昆虫：黄瓜条叶甲 (*Diabrotica balteata*) - 土壤中的幼虫

溶剂： 7 重量份丙酮

乳化剂： 1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

为制备适合的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合，加入给定量的乳化剂，并用水稀释该浓缩物至所需浓度。

将所述活性化合物制剂浇到土壤上。对此该制剂中活性化合物的浓度实际不起作用，起决定作用的只是每单位体积的土壤中活性化合物的重量，该重量用 ppm(mg/l)表示。将所述土壤装到 0.25 l 的盆中并在 20℃保存。

在配制完成后直接向各盆中放入 5 粒预发芽的 YIELD GUARD (Monsanto Comp., USA 的商标) 种的玉米粒。两天后向处理过的土壤中放入相应的测试昆虫。再过 7 天后通过计数露出土表的玉米苗确定活性化合物的活性程度 (1 棵植物 = 20% 活性)。

实施例 M

烟芽夜蛾 (*Heliothis virescens*) - 试验 - 处理转基因植物

溶剂： 7 重量份丙酮

乳化剂： 1 重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

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，并用水稀释浓缩物至所需浓度。

将各种 Rundup Ready (Monsanto Comp., USA 的商标) 的大豆嫩枝 (Glycine max) 通过浸入所需浓度的活性化合物制品中进行处理，并在大豆页仍然潮湿时放上烟夜蛾 (Tabakknospenraupe) 烟芽夜蛾。

在规定时间内测定昆虫的杀死率。