(19)中华人民共和国国家知识产权局

(12)发明专利

(10)授权公告号 CN 101466705 B
(45)授权公告日 2012.08.29

(21)申请号 200780019100.7

(22)申请日 2007.03.19

(30)优先权数据
102006015467.3 2006.03.31 DE

(85)PCT申请进入国家阶段日
2008.11.24

(86)PCT申请的申请数据
PCT/EP2007/002386 2007.03.19

(87)PCT申请的公布数据
WO2007/115644 DE 2007.10.18

(73)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 P·耶施克 R·维尔坦 T·申克
O·沙勒 M·E·贝克 R·庞特森
O·马萨姆 U·雷克曼 R·诺恩
U·戈根斯 L·彼得 T·穆勒
C·阿诺德 E·桑沃尔德

(74)专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司 11285
代理人 钟守期 唐铁军

(51)Int.Cl.
C07D 405/12(2006.01)
C07D 417/12(2006.01)
A01N 43/40(2006.01)
A01N 43/78(2006.01)

(56)对比文件
EP 0539588 A1,1993.05.05, 第3、16、19-22、26-28页.

审查员 李莎莎

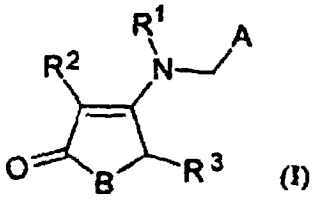
权利要求书 2 页 说明书 52 页

(54)发明名称

被取代的烯氨羰基化合物

(57)摘要

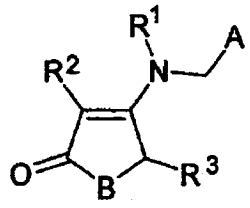
本发明涉及新的式(I)的被取代的烯氨羰基化合物,涉及制备所述化合物的方法及其用于防治动物害虫、特别是节肢动物、尤其是昆虫的用途。



(I)

CN 101466705 B

1. 式 (I) 化合物，



(I)

其中

A 代表任选 6 位被氟、氯、溴或三氟甲基取代的吡啶 -3- 基，或代表任选 2 位被氯取代的 1,3- 噻唑 -5- 基，

B 代表氧、硫或亚甲基，

R^1 代表卤代 $-C_{1-3}$ 烷基或卤代 $-C_{2-3}$ 烯基，

R^2 代表氢或卤素，并且

R^3 代表氢或甲基。

2. 权利要求 1 的式 (I) 化合物，其中

A 代表 6 位被氟、氯、溴或三氟甲基取代的吡啶 -3- 基，或代表 2- 氯 -1,3- 噻唑 -5- 基，

B 代表氧、硫或亚甲基，

R^1 代表卤代 $-C_{1-3}$ 烷基、卤代 $-C_{2-3}$ 烯基，其中卤素代表氟或氯，

R^2 代表氢或卤素，并且

R^3 代表氢或甲基。

3. 权利要求 1 的式 I 化合物，其中

A 代表 6- 溴吡啶 -3- 基，

B 代表氧，

R^1 代表 2- 氟乙基，

R^2 代表氢，并且

R^3 代表氢。

4. 权利要求 1 的式 I 化合物，其中

A 代表 6- 氟吡啶 -3- 基，

B 代表氧，

R^1 代表 2,2- 二氟乙基，

R^2 代表氢，并且

R^3 代表氢。

5. 权利要求 1 的式 I 化合物，其中

A 代表 6- 氯吡啶 -3- 基，

B 代表氧，

R^1 代表 2,2- 二氟乙基，

R^2 代表氯，并且

R^3 代表氢。

6. 权利要求 1 的式 I 化合物，其中

A 代表 6- 溴吡啶 -3- 基，

B 代表氧，

R^1 代表 2,2- 二氟乙基，

R^2 代表氢，并且

R^3 代表氢。

7. 权利要求 1 的式 I 化合物，其中

A 代表 6- 氯吡啶 -3- 基，

B 代表氧，

R^1 代表 2- 氟乙基，

R^2 代表氢，并且

R^3 代表氢。

8. 权利要求 1 的式 I 化合物，其中

A 代表 6- 氯吡啶 -3- 基，

B 代表氧，

R^1 代表 2,2- 二氟乙基，

R^2 代表氢，并且

R^3 代表氢。

9. 权利要求 1 的式 I 化合物，其中

A 代表 2- 氯 -1,3- 噻唑 -5- 基，

B 代表氧，

R^1 代表 2- 氟乙基，

R^2 代表氢，并且

R^3 代表氢。

10. 组合物，其特征在于该组合物含有至少一种权利要求 1-9 之一的式 (I) 化合物和常规的填充剂和 / 或表面活性剂。

11. 防治害虫的方法，其特征在于将权利要求 1-9 之一的式 (I) 化合物或权利要求 10 的组合物作用于害虫和 / 或其生境。

12. 权利要求 1-9 之一的式 (I) 化合物或权利要求 10 的组合物用于防治害虫的用途。

13. 权利要求 12 的用途，其中所述害虫是动物寄生虫。

14. 通过用权利要求 10 的组合物处理种子来保护种子和发芽植物免受害虫侵染的方法。

15. 权利要求 14 的方法，其中所述种子和植物通过遗传工程方法获得。

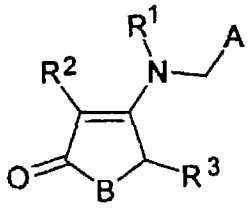
被取代的烯氨羰基化合物

[0001] 本发明涉及新的被取代的烯氨羰基 (enaminocarbonyl) 化合物，涉及其制备方法及其用于防治动物害虫、特别是节肢动物、尤其是昆虫的用途。

[0002] 已知被取代的烯氨羰基化合物为具有杀昆虫活性的化合物（参见 EP 0539588 A1）。

[0003] 本发明现提供新的式 (I) 化合物

[0004]



(I)

[0005] 其中

[0006] A 代表吡啶 -2- 基或吡啶 -4- 基，或代表任选 6 位被氟、氯、溴、甲基、三氟甲基或三氟甲氧基取代的吡啶 -3- 基，或代表任选 6 位被氯或甲基取代的哒嗪 -3- 基，或代表吡嗪 -3- 基，或代表 2- 氯吡嗪 -5- 基，或代表任选 2 位被氯或甲基取代的 1,3- 噻唑 -5- 基，

[0007] B 代表氧、硫或亚甲基，

[0008] R^1 代表卤代烷基、卤代烯基、卤代环烷基或卤代环烷基烷基，

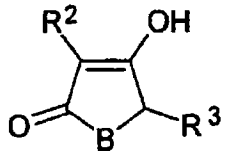
[0009] R^2 代表氢或卤素，并且

[0010] R^3 代表氢或烷基。

[0011] 此外，发现新的式 (I) 的被取代化合物通过如下方法获得：

[0012] a) 式 (II) 化合物与式 (III) 化合物反应，该反应如果合适在一种适宜的稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸性助剂的存在下进行（方法 1），

[0013]



(II)

[0014] 其中

[0015] B、R^2 和 R^3 如上定义，

[0016] $HN(R^1)-CH_2-A$ (III)

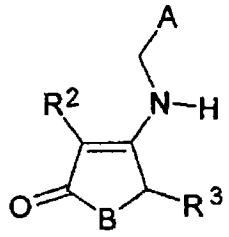
[0017] 其中

[0018] A 和 R^1 如上定义，

[0019] 或者

[0020] b) 式 (Ia) 化合物与式 (IV) 化合物反应，该反应如果合适在一种适宜的稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸受体的存在下进行（方法 2），

[0021]



(Ia)

[0022] 其中

[0023] A、B、R^2 和 R^3 如上定义，

[0024] E-R^1 (IV)

[0025] 其中

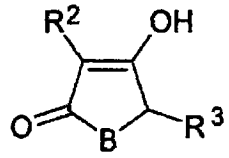
[0026] R^1 如上定义，并且

[0027] E 代表一个合适的离去基团，例如卤素（特别是溴、氯、碘）或 O- 磺酰基烷基及 O- 磺酰基芳基（特别是 O- 甲磺酰基、O- 甲苯磺酰基），

[0028] 或者

[0029] c) 在第一反应步骤中，式 (II) 化合物与式 (V) 化合物反应，该反应如果合适在一种适宜的稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸性助剂的存在下进行，然后在第二反应步骤中，将得到的式 (VI) 化合物与式 (VII) 化合物反应，该反应如果合适在一种适宜的稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸受体的存在下进行（方法 3），

[0030]



(II)

[0031] 其中

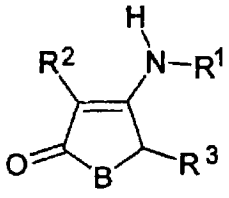
[0032] B、R^2 和 R^3 如上定义，

[0033] H_2N-R^1 (V)

[0034] 其中

[0035] R^1 如上定义，

[0036]



(VI)

[0037] 其中

[0038] B、R^1、R^2 和 R^3 如上定义，

[0039] E-CH_2-A (VII)

[0040] 其中

[0041] E 和 A 如上定义。

[0042] 最后，发现新的式 (I) 化合物具有突出的生物学特性并且尤其适于防治动物害虫，特别是在农业、森林、贮存产品的保护和材料保护、以及卫生领域中遇到的昆虫、蛛形纲

动物和线虫。

[0043] 尤其是根据取代基的性质，式（I）化合物可以几何异构体和／或旋光异构体或者不同组成的相应异构体混合物而存在。本发明既涉及纯异构体也涉及异构体混合物。

[0044] 式（I）提供本发明化合物的宽泛定义。

[0045] 以上及以下提及的式中给出的基团的优选取代基或范围说明如下。

[0046] A 优选代表 6- 氟吡啶 -3- 基、6- 氯吡啶 -3- 基、6- 溴吡啶 -3- 基、6- 甲基吡啶 -3- 基、6- 三氟甲基吡啶 -3- 基、6- 三氟甲氧基吡啶 -3- 基、6- 氯 -1,4- 哒嗪 -3- 基、6- 甲基 -1,4- 哒嗪 -3- 基、2- 氯 -1,3- 噻唑 -5- 基或 2- 甲基 -1,3- 噻唑 -5- 基。

[0047] B 优选代表氧或亚甲基。

[0048] R^1 优选代表氟取代的 C_1-C_5 烷基、C_2-C_5 烯基、C_3-C_5 环烷基或 C_3-C_5 环烷基烷基。

[0049] R^2 优选代表氢或卤素（其中卤素特别代表氟或氯）。

[0050] R^3 优选代表氢或甲基。

[0051] A特别优选代表基团6-氟吡啶-3-基、6-氯吡啶-3-基、6-溴吡啶-3-基、6-氯-1,4-哒嗪-3-基、2-氯-1,3-噻唑-5-基。

[0052] B 特别优选代表氧或亚甲基。

[0053] R^1 特别优选代表 2- 氟乙基、2,2- 二氟乙基、2- 氟环丙基。

[0054] R^2 特别优选代表氢。

[0055] R^3 特别优选代表氢。

[0056] A 非常特别优选代表基团 6- 氯吡啶 -3- 基、6- 溴吡啶 -3- 基或 6- 氯 -1,4- 哒嗪 -3- 基。

[0057] B 非常特别优选代表氧。

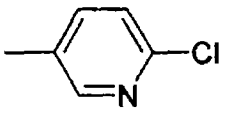
[0058] R^1 非常特别优选代表 2,2- 二氟乙基。

[0059] R^2 非常特别优选代表氢。

[0060] R^3 非常特别优选代表氢。

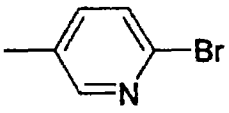
[0061] 在一类特定的式（I）化合物中，A 代表 6- 氯吡啶 -3- 基

[0062]



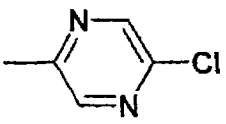
[0063] 在另一类特定的式（I）化合物中，A 代表 6- 溴吡啶 -3- 基

[0064]



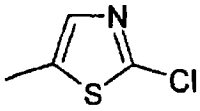
[0065] 在另一类特定的式（I）化合物中，A 代表 6- 氯 -1,4- 哒嗪 -3- 基

[0066]



[0067] 在另一类特定的式（I）化合物中，A 代表 2- 氯 -1,3- 噻唑 -5- 基

[0068]



[0069] 下文中，定义另一组优选的基团，其中

[0070] A 代表 6 位被氟、氯、溴、甲基或三氟甲基取代的吡啶 -3- 基，或代表 2- 氯吡嗪 -5- 基，或代表 2- 氯 -1,3- 噻唑 -5- 基，

[0071] B 代表氧、硫或亚甲基，

[0072] R^1 代表卤代 $-C_1-C_3$ 烷基、卤代 $-C_2-C_3$ 烯基、卤代环丙基（其中卤素特别代表氟或氯），

[0073] R^2 代表氢或卤素，并且

[0074] R^3 代表氢或甲基。

[0075] A 优选代表 6- 氟吡啶 -3- 基、6- 氯吡啶 -3- 基、6- 溴吡啶 -3- 基、6- 三氟甲基吡啶 -3- 基、2- 氯吡嗪 -5- 基或 2- 氯 -1,3- 噻唑 -5- 基。

[0076] B 优选代表氧或亚甲基。

[0077] R^1 优选代表二氟甲基、2- 氟乙基、2,2- 二氟乙基、2- 氯 -2- 氟乙基、3- 氟正丙基、2- 氟乙烯基、3,3- 二氟丙 -2- 烯基或 3,3- 二氯丙 -2- 烯基。

[0078] R^2 优选代表氢或卤素（其中卤素特别代表氟或氯）。

[0079] R^3 优选代表氢。

[0080] A 特别优选代表基团 6- 氯吡啶 -3- 基或 6- 溴吡啶 -3- 基。

[0081] B 特别优选代表氧。

[0082] R^1 特别优选代表 2- 氟乙基或 2,2- 二氟乙基。

[0083] R^2 特别优选代表氢。

[0084] R^3 特别优选代表氢。

[0085] A 非常特别优选代表基团 6- 氯吡啶 -3- 基或 6- 溴吡啶 -3- 基。

[0086] B 非常特别优选代表氧。

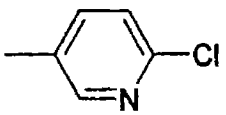
[0087] R^1 非常特别优选代表 2,2- 二氟乙基。

[0088] R^2 非常特别优选代表氢。

[0089] R^3 非常特别优选代表氢。

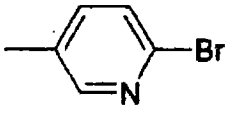
[0090] 在一类特定的式 (I) 化合物中，R^3 代表氢，B 代表氧，并且 A 代表 6- 氯吡啶 -3- 基

[0091]



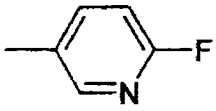
[0092] 在另一类特定的式 (I) 化合物中，R^3 代表氢，B 代表氧，并且 A 代表 6- 溴 - 吡啶 -3- 基

[0093]



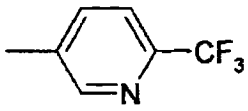
[0094] 在另一类特定的式 (I) 化合物中，R^3 代表氢，B 代表氧，并且 A 代表 6- 氟吡啶 -3- 基

[0095]



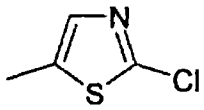
[0096] 在另一类特定的式(I)化合物中,R^3代表氢,B代表氧,并且A代表6-三氟甲基-吡啶-3-基

[0097]



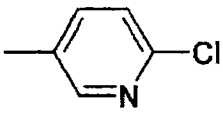
[0098] 在另一类特定的式(I)化合物中,R^3代表氢,B代表氧,并且A代表2-氯-1,3-噻唑-5-基

[0099]



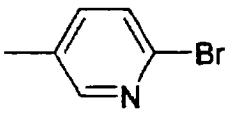
[0100] 在另一类特定的式(I)化合物中,R^2和R^3代表氢,B代表氧,并且A代表6-氯吡啶-3-基

[0101]



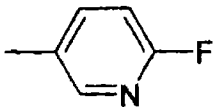
[0102] 在另一类特定的式(I)化合物中,R^2和R^3代表氢,B代表氧,并且A代表6-溴吡啶-3-基

[0103]



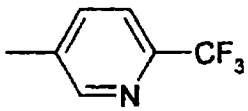
[0104] 在另一类特定的式(I)化合物中,R^2和R^3代表氢,B代表氧,并且A代表6-氟吡啶-3-基

[0105]



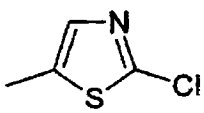
[0106] 在另一类特定的式(I)化合物中,R^2和R^3代表氢,B代表氧,并且A代表6-三氟甲基-吡啶-3-基

[0107]



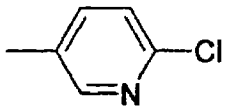
[0108] 在另一类特定的式(I)化合物中,R^2和R^3代表氢,B代表氧,并且A代表2-氯-1,3-噻唑-5-基

[0109]



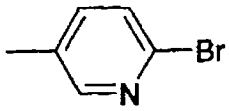
[0110] 在另一类特定的式 (I) 化合物中，R^2 和 R^3 代表氢，B 代表亚甲基，并且 A 代表 6- 氯吡啶 -3- 基

[0111]



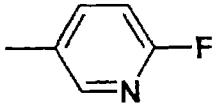
[0112] 在另一类特定的式 (I) 化合物中，R^2 和 R^3 代表氢，B 代表亚甲基，并且 A 代表 6- 溴吡啶 -3- 基

[0113]



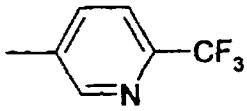
[0114] 在另一类特定的式 (I) 化合物中，R^2 和 R^3 代表氢，B 代表亚甲基，并且 A 代表 6- 氟吡啶 -3- 基

[0115]



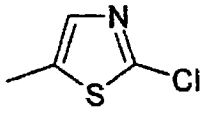
[0116] 在另一类特定的式 (I) 化合物中，R^2 和 R^3 代表氢，B 代表亚甲基，并且 A 代表 6- 三氟甲基 - 吡啶 -3- 基

[0117]



[0118] 在另一类特定的式 (I) 化合物中，R^2 和 R^3 代表氢，B 代表亚甲基，并且 A 代表 2- 氯 -1,3- 噻唑 -5- 基

[0119]



[0120] 在另一类特定的式 (I) 化合物中，R^1 代表二氟甲基，R^2 和 R^3 代表氢，并且 B 代表氧。

[0121] 在另一类特定的式 (I) 化合物中，R^1 代表 2- 氟乙基，R^2 和 R^3 代表氢，并且 B 代表氧。

[0122] 在另一类特定的式 (I) 化合物中，R^1 代表 2,2- 二氟乙基，R^2 和 R^3 代表氢，并且 B 代表氧。

[0123] 在另一类特定的式 (I) 化合物中，R^1 代表二氟甲基，R^2 和 R^3 代表氢，并且 B 代表亚甲基。

[0124] 在另一类特定的式 (I) 化合物中，R^1 代表 2- 氟乙基，R^2 和 R^3 代表氢，并且 B 代表亚甲基。

[0125] 在另一类特定的式 (I) 化合物中，R^1 代表 2,2- 二氟乙基，R^2 和 R^3 代表氢，并且 B 代表亚甲基。

[0126] 以上给出的宽泛的或优选的基团定义或解释既适用于终产物，也相应地适用于前

体和中间体。这些基团定义可按需要相互组合，即包括各个优选范围之间的组合。

[0127] 本发明优选含有以上作为优选所列含义的组合的式 (I) 化合物。

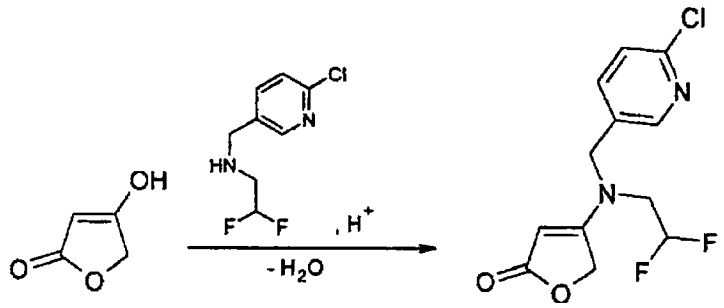
[0128] 本发明特别优选含有以上作为特别优选所列含义的组合的式 (I) 化合物。

[0129] 本发明非常特别优选含有以上作为非常特别优选所列含义的组合的式 (I) 化合物。

[0130] 在制备新的式 (I) 化合物的本发明方法 1 中，如果式 (II) 化合物为例如特窗酸并且式 (III) 化合物为 N-[6- 氯吡啶 -3- 基) 甲基]-2,2- 二氟乙 -1- 胺，则制备方法 1 可通过以下反应方案表示：

[0131] 方案 I

[0132]



[0133] 式 (II) 提供了作为实施本发明方法 1 所需原料的化合物的宽泛定义。

[0134] 在式 (II) 中，B、R^2 和 R^3 优选代表已在有关本发明式 (I) 化合物的描述中作为优选取代基而提及的那些基团。

[0135] 一些式 (II) 化合物可商购获得或通过文献中已知的方法获得 (参见，例如其中 B 代表氧的通式 (II) 的化合物 :特窗酸 (Said, A. Speciality Chemicals Magazine(1984), 4(4),7-8 ;Rao, Y. S. Chem. Rev. (1976),76,625-694 ;Tejedor, D. ;Garcia-Tellado, F. Org. Preparations and Procedures International(2004),36,35-59 ;Reviews) ;其中 B 代表硫的通式 (II) 的化合物 :硫代特窗酸 (Thomas,E. J. Special Publication-Royal Society of Chemistry(1988),65(Top. Med. Chem.),284-307, Review) ;其中 B 代表亚甲基的通式 (II) 的化合物 :环戊 -1,3- 二酮 (Schick, Hans ;Eichhorn, Inge. Synthesis(1989), (7), 477-492, Review)。

[0136] 式 (III) 提供了作为实施本发明方法 1 另外原料的化合物的宽泛定义。

[0137] 在式 (III) 中，A 和 R^1 具有已在有关本发明式 (I) 化合物的描述中提及的含义。

[0138] 一些式 (III) 化合物可商购获得或通过文献中已知方法获得 (参见，例如 S. Patai “The Chemistry of Amino Group”, Interscience Publishers, New York, 1968 ; 其中 R^1 代表氢的通式 (III) 化合物 :伯胺，其中 R^1 代表卤代烷基、卤代烯基或卤代环烷基的通式 (III) 化合物 :仲胺)。

[0139] 式 (III) 化合物可由式 (VII) 化合物制备 (参见以下方案 III)。

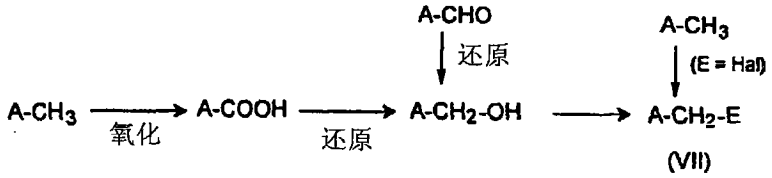
[0140] 一些式 (VII) 化合物可商购获得，一些为已知的，并且它们可由已知方法获得 (例如 2- 氯 -5- 氯甲基 -1,3- 噻唑 :DE 3 631 538(1988)、EP 446 913(1991)、EP 780 384(1997)、EP 775 700(1997)、EP 794180(1997)、WO 9 710 226(1997) ;6- 氯 -3- 氯甲基吡啶 :DE 3 630 046A1(1998)、EP 373 464 A2(1990)、EP 373 464 A2(1990)、EP 393 453A2(1990)、EP 569 947 A1(1993) ;6- 氯 -3- 溴甲基吡啶 :I. Cabanal-Duvillard et

al.，Heterocycl.Commun.，5，257-262(1999)；6- 溴 -3- 氯 甲 基 吡 啶、6- 溴 -3- 羟 甲 基 吡啶：美国专利 5 420 270 A(1995)；6- 氟 -3- 氯甲基吡啶：J.A.Pesti et al.，J.Org. Chem.65，7718-7722(2000)；6- 甲基 -3- 氯甲基吡啶：EP 302389 A2，E.v der Eycken et al.，J.Chem.Soc.Perkin Trans 25，928-937(2002)；6- 三氟甲基 -3- 氯 甲 基 吡 啶：WO 2004/082616 A2；2- 氯 -5- 氯甲基吡嗪：JP 05239034 A2)。

[0141] 制备式 (VII) 化合物的一般路线示于反应方案 II 中。

[0142] 方案 II

[0143]



[0144] E ＝ Hal，例如氯、溴、碘，O- 甲苯磺酰基、O- 甲磺酰基，

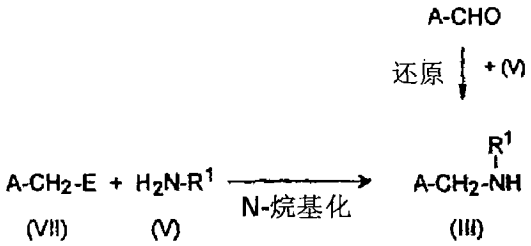
[0145] A ＝如上定义

[0146] 杂环羧酸 (A-COOH) 可例如通过文献中已知方法转化为相应的杂环羟甲基化合物 (A-CH_2-OH)，然后该杂环羟甲基化合物通过文献中已知的方法反应从而得到活化的杂环羟甲基化合物 (A-CH_2-E，E ＝ O- 甲苯磺酰基、O- 甲磺酰基）或杂环卤代甲基化合物 (A-CH_2-E，E ＝ Hal)。所述杂环卤代甲基化合物也可使用文献中已知的适宜卤化剂由相应的含甲基基团的杂环 (A-CH_3) 获得。

[0147] 为制备式 (III) 化合物，使其中 A 和 E 如上定义的式 (VII) 化合物与其中 R^1 如上定义的式 (V) 化合物进行反应较为有利，反应如果合适在稀释剂的存在下并且如果合适在制备方法 2 中提及的碱性反应助剂的存在下进行（参见 N- 烷基化，方案 III)。

[0148] 方案 III

[0149]



[0150] E ＝ Hal，例如氯、溴、碘；O- 甲苯磺酰基、O- 甲磺酰基

[0151] A ＝如上定义

[0152] 一些式 (V) 化合物可商购获得（参见，例如 2- 氟乙胺或 2,2- 二氟乙胺）或由文献中已知方法获得（参见，例如 3- 氟正丙胺：US 6252087B1；3,3- 二氟丙 -2- 烯基胺氢氯化物：WO 2001/007414 A1；3,3- 二氯丙 -2- 烯基胺：DE 2747814)。

[0153] 但是，作为选择方案，在某些情况下，也可由相应的醛 (A-CHO) 和式 (V) 化合物通过还原性胺化反应制备式 (III) 化合物（参见 Houben-Weyl，Methoden der Organischen Chemie，Vol.XI/1，GeorgThieme Verlag Stuttgart，p.602)。一些醛 (A-CHO) 可商购获得（参见，例如 6- 氯烟碱醛、6- 氟烟碱醛、6- 溴烟碱醛、2- 氯 -1,3- 噻唑 -5- 甲醛)，或者它们可通过文献中已知方法获得（参见，例如 6- 甲基烟碱醛：EP 104876 A2；2- 氯吡嗪 -5- 甲

醛 :DE 3314196 A1)。

[0154] 通常,在稀释剂的存在下实施本发明制备方法 1 较为有利。稀释剂有利地以使反应混合物在整个过程中保持易于搅拌的量使用。实施本发明方法 1 的适宜的稀释剂为所有在反应条件下呈惰性的有机溶剂。

[0155] 可提及的实例有 :卤代烃,特别是氯代烃,例如四氯乙烯、四氯乙烷、二氯丙烷、二氯甲烷、二氯丁烷、氯仿、四氯化碳、三氯乙烷、三氯乙烯、五氯乙烷、二氟苯、1,2- 二氯乙烷、氯苯、溴苯、二氯苯、氯甲苯、三氯苯 ;醇,例如甲醇、乙醇、异丙醇、丁醇 ;醚,例如乙基丙基醚、甲基叔丁基醚、正丁醚、苯甲醚、苯乙醚、环己基甲基醚、二甲醚、乙醚、二丙醚、二异丙醚、二正丁基醚、二异丁醚、二异戊醚、乙二醇二甲醚、四氢呋喃、二噁烷、二氯二乙基醚,以及环氧乙烷和 / 或环氧丙烷的聚醚 ;胺,例如三甲胺、三乙胺、三丙胺、三丁胺、N- 甲基吗啉、吡啶和四亚甲基二胺 ;硝化烃,例如硝基甲烷、硝基乙烷、硝基丙烷、硝基苯、氯硝基苯、邻硝基甲苯 ;腈,例如乙腈、丙腈、丁腈、异丁腈、苄腈、间氯苄腈 ;以及其他化合物,例如四氢噻吩二氧化物和二甲基亚砜、四亚甲基亚砜、二丙基亚砜、苄基甲基亚砜、二异丁基亚砜、二丁基亚砜、二异戊基亚砜 ;砜,例如二甲砜、二乙砜、二丙砜、二丁砜、二苯砜、二己砜、甲基乙基砜、乙基丙基砜、乙基异丁基砜和五亚甲基砜 ;脂族烃、脂环族烃或芳香族烃,例如戊烷、己烷、庚烷、辛烷、壬烷 ;以及工业烃,例如具有沸点在例如 40℃ -250℃范围内的组分的石油溶剂、伞花烃、沸程 70℃ -190℃的石油馏分、环己烷、甲基环己烷、石油醚、挥发油、辛烷、苯、甲苯、氯苯、溴苯、硝基苯、二甲苯 ;酯,例如乙酸甲酯、乙酸乙酯、乙酸丁酯、乙酸异丁酯,以及碳酸二甲酯、碳酸二丁酯、碳酸亚乙酯 ;酰胺,例如六亚甲基磷酸三酰胺、甲酰胺、N- 甲基甲酰胺、N,N- 二甲基甲酰胺、N,N- 二丙基甲酰胺、N,N- 二丁基甲酰胺、N- 甲基吡咯烷、N- 甲基己内酰胺、1,3- 二甲基 -3,4,5,6- 四氢 -2(1H)- 嘧啶、辛基吡咯烷酮、辛基己内酰胺、1,3- 二甲基 -2- 咪唑啉二酮、N- 甲酰基哌啶、N,N’-1,4- 二甲酰基哌嗪 ;酮,例如丙酮、苯乙酮、甲基乙基酮、甲基丁基酮。

[0156] 也可使用本发明方法提及的溶剂和稀释剂的混合物。

[0157] 但是,实施本发明方法的优选稀释剂为芳烃,例如苯、甲苯、氯苯、溴苯、硝基苯或二甲苯,特别是苯和甲苯。

[0158] 本发明制备方法 1 的式 (I) 化合物的制备是通过在式 (III) 化合物的存在下使式 (II) 化合物反应来实施的,反应如果合适在一种酸性助剂的存在下并且如果合适在一种所提及的稀释剂中进行。

[0159] 反应时间一般为 10 分钟至 48 小时。反应在 -10℃和 +200℃之间、优选在 +10℃和 180℃之间、特别优选在 60℃和 140℃之间的温度进行。反应优选在可使水分出或除去的反应条件下进行,例如借助分水器。

[0160] 原理上,反应可在大气压下进行。反应优选在大气压下或最高至 15 巴的压力下进行,并且,如果合适,在保护气 (氮、氦或氩) 的气氛下进行。

[0161] 为实施本发明方法 1,每摩尔通式 (II) 的化合物通常使用 0.5-4.0mol、优选 0.7-3.0mol、特别优选 1.0-2.0mol 通式 (III) 的氨基化合物。

[0162] 此外,为实施本发明方法 1,一般可添加催化量的酸性助剂。

[0163] 适宜的酸性助剂有,例如对甲苯磺酸或乙酸。

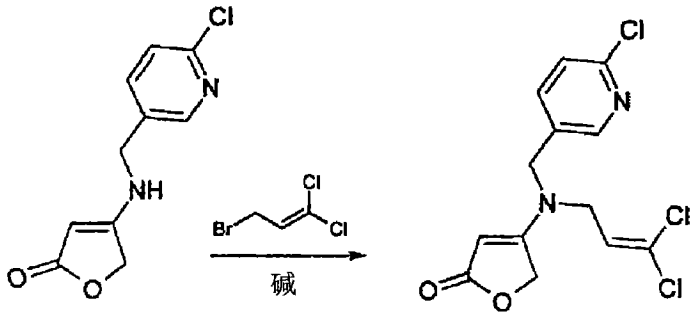
[0164] 反应完成之后,浓缩全部的反应混合物。后处理之后获得的产物可以常规方式通

过重结晶、减压蒸馏或柱色谱法进行纯化（另外参见制备实施例）。

[0165] 在制备新的式 (I) 化合物的本发明方法 2 中，如果式 (Ia) 的化合物为例如 4-[[(6- 氯吡啶 -3- 基）甲基］氨基］呋喃 -2(5H)- 酮并且式 (IV) 的化合物为 3- 溴 -1，1- 二氯丙 -1- 烯，则制备方法 2 可通过以下反应方案 IV 表示：

[0166] 方案 IV

[0167]



[0168] 式 (Ia) 提供了作为实施本发明方法 2 所需原料的化合物的宽泛定义。

[0169] 在式 (Ia) 中，A、B、R^2 和 R^3 优选代表那些已在有关本发明式 (I) 化合物的描述中作为优选取代基提及的基团。

[0170] 式 (Ia) 化合物可通过以上描述的制备方法 1 获得，例如通过式 (II) 化合物与其中 R^1 代表氢的式 (III) 化合物反应而获得。

[0171] 式 (IV) 提供特别是用作实施本发明方法 2 的原料的化合物的宽泛定义。

[0172] 式 (IV) 中，E 和 R^1 具有已在有关本发明通式 (I) 化合物的描述中提及的取代基含义。

[0173] 一些式 (IV) 化合物可商购获得（参见，例如氯二氟甲烷、1- 溴 -2- 氟乙烷、2- 溴 -1，1- 二氟乙烷、2- 溴 -1- 氯 -1- 氟乙烷、1- 溴 -3- 氟丙烷、3- 溴 -1，1- 二氟丙 -1- 烯），或者它们可通过文献中已知的方法获得（参见，例如 3- 溴 -1，1- 二氯丙 -1- 烯 ；WO 8800183 A1(1988) ；其中 E 代表卤素例如氯、溴和碘的通式 IV 的化合物 ：Houben-Weyl，Methodender Organischen Chemie，Vol.V/3，Georg Thieme Verlag Stuttgart，p.503 and Vol.V/4 p.13，517 ；其中 E 代表甲磺酸根的式 (IV) 的化合物 ：Crossland，R.K.，Servis，K.L.J.Org. Chem.(1970)，35，3195 ；其中 E 代表甲苯磺酸根的式 (IV) 化合物 ：Roos，A.T.et al.，Org. Synth.，Coll.Vol.I，(1941)，145 ；Marvel，C.S.，Sekera，V.C.Org.Synth.，Coll.Vol.III，(1955)，366)。

[0174] 一般而言，在稀释剂的存在下和在碱性反应助剂的存在下实施本发明制备方法 2 较为有利。

[0175] 稀释剂有利地以使反应混合物在整个过程中保持易于搅拌的量使用。实施本发明方法 2 的适宜的稀释剂为所有的惰性有机溶剂。

[0176] 实施本发明方法 2 的优选稀释剂有醚，例如甲基叔丁基醚、正丁醚、苯甲醚、苯乙醚、环己基甲基醚、二异丙醚、二异丁醚、二异戊醚、乙二醇二甲醚、四氢呋喃、二噁烷、二氯二乙基醚，及环氧乙烷和 / 或环氧丙烷的聚醚 ；酰胺，例如六亚甲基磷酸三酰胺、甲酰胺、N- 甲基甲酰胺、N，N- 二甲基甲酰胺、N，N- 二丙基甲酰胺、N，N- 二丁基甲酰胺、苯、甲苯、氯苯、溴苯、硝基苯、二甲苯 ；酮，例如丙酮、苯乙酮、甲基乙基酮或甲基丁基酮。

[0177] 当然，也可使用本发明方法提及的溶剂和稀释剂的混合物。

[0178] 但是，实施本发明方法的优选的稀释剂为醚，例如甲基叔丁基醚或环醚，例如四氢呋喃和二噁烷；酰胺，例如 N，N- 二甲基甲酰胺；芳烃，例如苯或甲苯；酮，例如丙酮、甲基乙基酮或甲基丁基酮。

[0179] 适宜用作实施本发明方法 2 的碱性反应助剂的为所有适宜的酸结合剂，例如胺，特别是叔胺，以及碱金属和碱土金属化合物。

[0180] 可提及的实例为锂、钠、钾、镁、钙及钡的氢氧化物、氢化物、氧化物和碳酸盐，以及其他的碱性化合物，例如脒碱或胍碱，如 7- 甲基 -1,5,7- 三氮杂双环 [4.4.0] 癸 -5- 烯 (MTBD)；二氮杂双环 [4.3.0] 壬烯 (DBN)、二氮杂双环 [2.2.2] 辛烷 (DABCO)、1,8- 二氮杂双环 [5.4.0] 十一碳烯 (DBU)、环己基四丁基胍 (CyTBG)、环己基四甲基胍 (CyTMG)、N,N,N,N- 四甲基 -1,8- 萘二胺、五甲基哌啶，叔胺，例如三乙胺、三甲胺、三苄胺、三异丙基胺、三丁胺、三环己胺、三戊胺、三己胺、N，N- 二甲基苯胺、N，N- 二甲基甲苯胺、N，N- 二甲基对氨基吡啶、N- 甲基吡咯烷、N- 甲基哌啶、N- 甲基咪唑、N- 甲基吡唑、N- 甲基吗啉、N- 甲基六亚甲基二胺、吡啶、4- 吡咯烷基吡啶、4- 二甲基氨基吡啶、喹啉、α - 甲基吡啶、β - 甲基吡啶、异喹啉、嘧啶、吖啶、N，N，N’，N’ - 四亚甲基二胺、N，N，N’，N’ - 四亚乙基二胺、喹喔啉、N- 丙基二异丙胺、N- 乙基二异丙胺、N,N’ - 二甲基环己胺、2,6- 二甲基吡啶、2,4- 二甲基吡啶或三乙基二胺。

[0181] 优选使用锂或钠的氢化物。

[0182] 反应时间一般从 10 分钟至 48 小时。反应在 -10℃和 +200℃之间、优选在 +10℃和 180℃之间、特别优选在 60℃和 140℃之间的温度进行。原理上，反应可在大气压下进行。反应优选在大气压下或最高至 15 巴的压力下进行，并且如果合适，在保护气（氮、氦或氩）的气氛下进行。

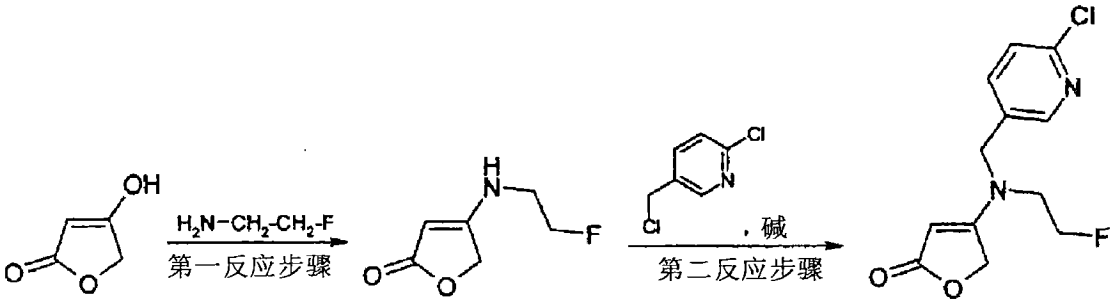
[0183] 为实施本发明方法 2，每摩尔式 (II) 化合物通常使用 0.5-4.0mol、优选 0.7-3.0mol、特别优选 1.0-2.0mol 式 (IV) 的烷基化剂。

[0184] 反应完成之后，浓缩全部的反应混合物。后处理之后获得的产物可以常规方式通过重结晶、减压蒸馏或柱色谱法进行纯化（另外参见制备实施例）。

[0185] 在制备新的式 (I) 化合物的本发明方法 3 中，在第一反应步骤中，如果所用式 (II) 化合物为例如特窗酸，且式 (V) 化合物为 2- 氟乙胺，并且在第二反应步骤中，得到的式 (VI) 化合物为 4-[(2- 氟乙基）氨基］呋喃 -2(5H)- 酮，该酮用式 (VII) 化合物例如 2- 氯 -5-（氯甲基）吡啶进行 N- 烷基化，则制备方法 3 可用以下反应方案 V 来表示：

[0186] 方案 V

[0187]



[0188] 式 (II) 提供了实施本发明方法 3 所需原料化合物的宽泛定义，并且这些化合物已

在上述提及的有关方法 1 中进行了更详细的描述。

[0189] 式 (V) 提供了用作实施本发明方法 3 其他原料的化合物的宽泛定义。

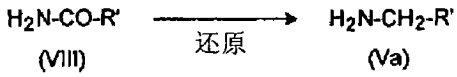
[0190] 式 (V) 中，R^1 具有已在有关本发明式 (I) 化合物的描述中提及的含义。

[0191] 式 (V) 的氨基化合物以一般方式定义，并且在许多情况下，一些式 (V) 的氨基化合物可商购获得（参见，例如 2- 氟乙胺或 2,2- 二氟乙胺），或者它们可以本身已知的方式通过 Leuckart-Wallach 反应获得（例如 2- 氟乙胺：美国专利 4030994(1977)；其中 R^1 代表烷基、伯胺的式 V 的化合物：参见例如 Houbel-Weyl, Methoden derOrganischen Chemie, Vol. XI/1, 4th. Ed. 1957, Georg. ThiemeVerlag, Stuttgart, p. 648；M. L. Moore, "The Leuckart Reaction", Organic Reactions, Vol. 5, 2nd. Ed. 1952, New York, John Wiley& Sons, Inc. London)（另外参见，例如 3- 氟正丙胺：US 6252087 B1；3,3- 二氟丙 -2- 烯基胺氢氯化物：WO 2001/007414 A1；3,3- 二氯丙 -2- 烯基胺：DE 2747814；2- 氯 -2- 氟环丙胺、2,2- 二氯环丙胺：K. R. Gassen, B. Baasner, J. Fluorine Chem. 49, 127-139, 1990)。

[0192] 或者，其中 R^1 代表 CH_2-R'（R' = 含卤素的基团；卤素 = 氟或氯）的某些式 (Va) 的氨基化合物也可通过在适宜的还原剂的存在下还原卤代甲酰胺 (VIII) 而获得（反应方案 VI）。

[0193] 方案 VI

[0194]



[0195] R' = 含卤素的基团

[0196] 一种优选的还原剂为例如已知的硼烷 - 甲硫醚络合物（另外参见由市售的 2- 氯 -2- 氟乙酰胺制备 2- 氯 -2- 氟乙 -1- 胺）。

[0197] 式 (VII) 提供了用作实施本发明方法 3 的其他原料的化合物的宽泛定义。

[0198] 式 (VII) 中，E 和 A 具有已在有关本发明式 (I) 化合物的描述中提及的含义。

[0199] 如上所提及，一些式 (VII) 的化合物可商购获得，一些为已知或者它们可由已知方法获得。

[0200] 通常，在稀释剂的存在下实施本发明制备方法 3 的第一个反应步骤较为有利。稀释剂有利地以使反应混合物在整个过程中保持易于搅拌的量使用。实施本发明方法 3 的适宜的稀释剂为所有的惰性有机溶剂。

[0201] 实施本发明方法 3 的第一个反应步骤的优选的稀释剂为芳烃，例如苯、甲苯、氯苯、溴苯、硝基苯或二甲苯，特别是苯和甲苯。

[0202] 在第二个反应步骤中，式 (VI) 的化合物用式 (VII) 化合物进行 N- 烷基化。

[0203] 通常，在稀释剂的存在下和在碱性反应助剂例如氢化钠的存在下实施本发明制备方法 3 的第二个反应步骤较为有利。

[0204] 该反应步骤的适宜的稀释剂为例如醚，例如四氢呋喃或二噁烷。

[0205] 稀释剂有利地以使反应混合物在整个过程中保持易于搅拌的量使用。

[0206] 反应时间一般从 10 分钟至 48 小时。

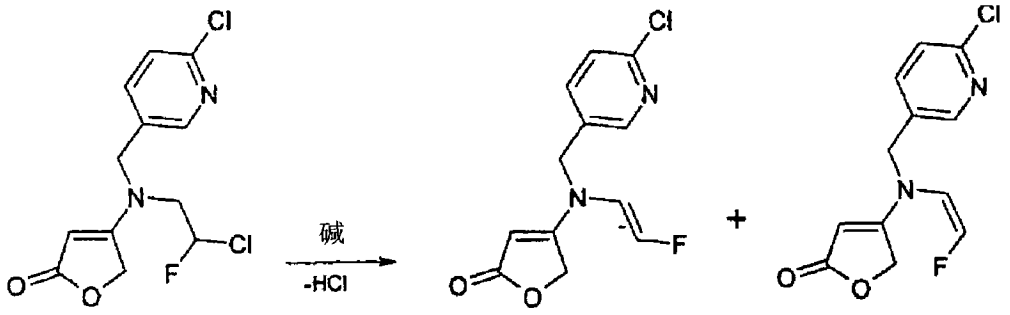
[0207] 反应在 -10℃和 +200℃之间、优选在 +10℃和 180℃之间、特别优选在 60℃和 140℃之间的温度进行。该反应优选在使水分出或除去的反应条件下进行，例如借助于分水器。

[0208] 反应完成之后，浓缩全部的反应混合物。后处理之后获得的产物可以常规方式通过重结晶、减压蒸馏或柱色谱法进行纯化（另外参见制备实施例）。

[0209] 为制备其中 R^2 代表 2- 氟乙烯基基团的式 (I) 化合物，根据本发明，将其中 R^2 代表 2- 氯 -2- 氟乙基基团的式 (I) 化合物在一种碱性助剂的存在下进行脱卤化氢（即进行正规的 HCl 消除），如反应方案 (VII) 所示。反应产物可以几何异构体的形式存在，例如 (E) 和 (Z) 异构体（或反式和顺式异构体）。

[0210] 方案 VII

[0211]



(E)- 异构体 (Z)- 异构体

[0212] 在脱卤化氢所需原料式 (I) 化合物中，A、B、R^2 和 R^3 如上定义，取代基 R^1 具有的含义为 2- 氯 -2- 氟乙基。

[0213] 这些式 (I) 化合物可通过以上提及的制备方法 1 至 3 获得。

[0214] 通常，在稀释剂的存在下实施脱卤化氢较为有利。稀释剂有利地以使反应混合物在整个过程中保持易于搅拌的量使用。实施 C- 烷基化的适宜的稀释剂为所有在反应条件下呈惰性的有机溶剂。

[0215] 实施脱卤化氢的优选的稀释剂为醇，例如甲醇、乙醇、异丙醇、丁醇。也可使用本发明方法中提及的溶剂和稀释剂的混合物。

[0216] 实施本发明方法的优选稀释剂为醇，例如乙醇或丁醇。

[0217] 式 (I) 化合物的脱卤化氢通过使其与通式 (I) 的化合物在碱性反应助剂的存在下进行反应来实施。

[0218] 通常地，所用碱性反应助剂有利地为碱金属氢氧化物，例如氢氧化钠或氢氧化钾。

[0219] 反应时间一般从 10 分钟至 48 小时。

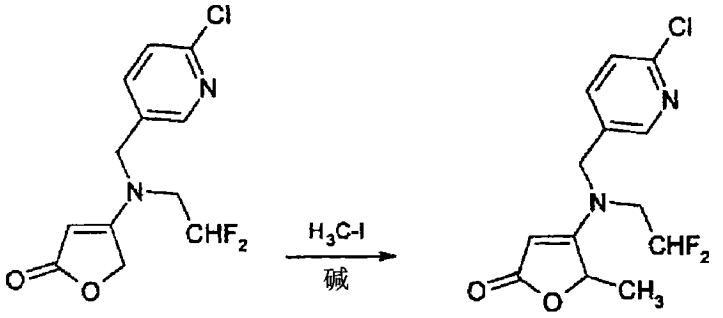
[0220] 反应在 -100℃和 +80℃之间、优选在 -20℃和 50℃之间、特别优选在室温的温度进行。

[0221] 反应完成之后，浓缩全部的反应混合物。后处理之后获得的产物可以常规方式通过重结晶、减压蒸馏或柱色谱法进行纯化。使用已知分析方法检测几何异构体，例如 (E) 和 (Z) 异构体。在以上提及的实例中，例如存在 (15:85) 比例的 (E/Z) 异构体混合物（另外参见制备实施例）。

[0222] 为制备其中 R^3 代表烷基的式 (I) 化合物，根据本发明，使其中 R^3 代表氢的式 (I) 化合物与式 (IV) 化合物在碱性助剂的存在下根据反应方案 (VIII) 进行反应。

[0223] 方案 VIII

[0224]



[0225] 在 C- 烷基化所需原料式 (I) 化合物中，A、B、R^2 和 R^3 如上定义，取代基 R^1 代表氢。

[0226] 这些式 (I) 化合物可通过以上提及的制备方法 1 至 3 获得。

[0227] 通常，在稀释剂的存在下实施 C- 烷基化较为有利。稀释剂有利地以使反应混合物在整个过程中保持易于搅拌的量使用。实施 C- 烷基化的适宜的稀释剂为所有惰性有机溶剂。

[0228] 实施 C- 烷基化的优选的稀释剂为醚，例如甲基叔丁基醚、正丁基醚、苯甲醚、苯乙醚、环己基甲基醚、二异丙醚、二异丁醚、二异戊醚、乙二醇二甲醚、四氢呋喃、二噁烷、二氯二乙基醚，及环氧乙烷和 / 或环氧丙烷的聚醚。

[0229] 也可使用本发明方法提及的溶剂和稀释剂的混合物。

[0230] 实施本发明方法的优选的稀释剂为醚，例如甲基叔丁基醚或环醚，如四氢呋喃和二噁烷。

[0231] C- 烷基化通过使适宜的式 (I) 原料与式 (IV) 化合物在碱性反应助剂的存在下进行反应来实施。

[0232] 反应时间一般从 10 分钟至 48 小时。

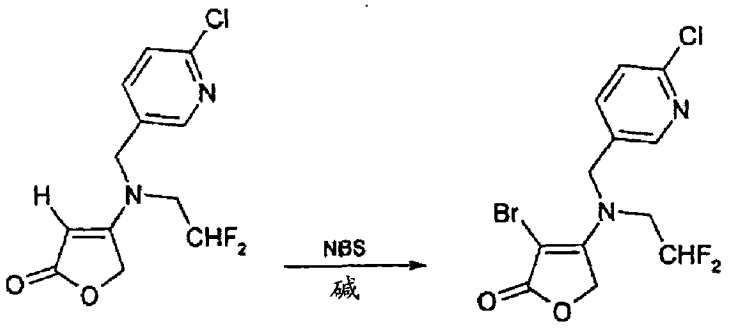
[0233] 反应在 -100℃和 +20℃之间、优选在 -90℃和 10℃之间、特别优选在 -80℃和 0℃之间的温度进行。

[0234] 反应完成之后，浓缩全部的反应混合物。后处理之后获得的产物可以常规方式通过重结晶、减压蒸馏或柱色谱法进行纯化 (另外参见制备实施例)。

[0235] 为制备其中 R^2 代表卤素的式 (I) 化合物，或者，也可使其中 R^2 代表氢的式 (I) 化合物与卤化剂在碱性助剂的存在下根据反应方案 (IX) 进行反应。

[0236] 方案 IX

[0237]



[0238] NBS :N- 溴琥珀酰亚胺

[0239] 在作为所需原料的式 (I) 化合物中，A、B、R^1 和 R^3 如上定义，取代基 R^2 代表氢。

[0240] 这些式 (I) 化合物可通过以上提及的制备方法 1 至 3 获得。

[0241] 通常，在稀释剂的存在下实施卤化较为有利。稀释剂有利地以使反应混合物在整

个过程中保持易于搅拌的量使用。实施卤化的适宜的稀释剂为所有在反应条件下呈惰性的有机溶剂。

[0242] 实施本发明方法的适宜的卤化剂为所有适宜的卤化剂，例如 N- 卤代化合物。

[0243] 可提及的实例为 N- 卤代胺，例如 1- 氯甲基 -4- 氟重氮双环 [2.2.2] 辛烷 - 二 -(四氟硼酸酯)(Selectfluor®)，N，N- 二卤代胺、N- 卤代甲酰胺、N- 卤代脲酸酯 (N-halocarbamidic acid ester)、N- 卤代脲、N- 卤代磺酰胺、N- 卤代 - 二磺酰胺，N- 卤代磺酰亚胺，例如 N- 氟二 [(三氟甲基) 磺酰基] 亚胺，以及 N- 卤代羧酸二酰胺，例如 N- 氯邻苯二甲酰亚胺、N- 溴邻苯二甲酰亚胺、N- 碘邻苯二甲酰亚胺、N- 氯代琥珀酰亚胺 (NCS)、N- 溴代琥珀酰亚胺 (NBS)、N- 溴代糖精或 N- 碘代琥珀酰亚胺。

[0244] 实施卤化的优选的卤化剂为 N- 卤代羧酸二酰胺或 1- 氯甲基 -4- 氟重氮双环 [2.2.2] 辛烷 - 二 -(四氟硼酸酯)(Selectfluor®)。

[0245] 实施卤化的优选的稀释剂为腈，例如乙腈、丙腈、丁腈、异丁腈、苄腈、间氯苄腈。

[0246] 也可使用本发明方法提及的溶剂和稀释剂的混合物。

[0247] 实施本发明方法的特别优选的稀释剂为腈，例如乙腈、丙腈或丁腈。

[0248] 本方法的反应时间一般从 10 分钟至 48 小时。

[0249] 反应在 -10℃和 +100℃之间、优选在 0℃和 60℃之间、特别优选在 10℃和室温之间的温度进行。

[0250] 反应完成之后，浓缩全部的反应混合物。后处理之后获得的产物可以常规方式通过重结晶、减压蒸馏或柱色谱法进行纯化 (另外参见制备实施例)。

[0251] 如果合适，式 (I) 化合物可以不同的多晶型物或不同的多晶型物的混合物而存在。纯多晶型物和多晶型混合物均由本发明提供并可根据本发明使用。

[0252] 本发明的活性化合物，具有良好的植物耐受性和对温血动物有利的毒性并具有良好的环境耐受性，适于保护植物和植物器官、提高采收产率、改善采收物的质量和用于防治动物害虫，特别是农业、园艺、畜牧业、森林、园林和休闲设施、贮存产品和材料的保护及卫生领域中遇到的昆虫、蛛形纲动物、蠕虫、线虫和软体动物。它们可优选用作植物保护剂。它们对通常敏感及抗性物种及所有或部分发育阶段均具有活性。上述害虫包括 :

[0253] 虱目 (Anoplura)(Phthiraptera)，例如，畜虱属 (Damaliniaspp.)、血虱属 (Haematopinus spp.)、毛虱属 (Linognathus spp.)、虱属 (Pediculus spp.)、嚼虱属 (Trichodectes spp.)。

[0254] 蛛形纲 (Arachnida)，例如，粗脚粉螨 (Acarus siro)、柑橘瘤瘿螨 (Aceria sheldoni)、刺皮瘿螨属 (Aculops spp.)、针刺瘿螨属 (Aculus spp.)、花蜱属 (Amblyomma spp.)、锐缘蜱属 (Argasspp.)、牛蜱属 (Boophilus spp.)、短须螨属 (Brevipalpus spp.)、苜蓿苔螨 (Bryobia praetiosa)、皮螨属 (Chorioptes spp.)、鸡皮刺螨 (Dermanys susgallinae)、始叶螨属 (Eotetranychus spp.)、梨上瘿螨 (Epitrimerus pyri)、真叶螨属 (Eutetranychus spp.)、瘿螨属 (Eriophyes spp.)、半跗线螨属 (Hemitarsonemus spp.)、璃眼蜱属 (Hyalomma spp.)、硬蜱属 (Ixodes spp.)、黑寡妇蜘蛛 (Latrodectus mactans)、Metatetranychus spp.、小爪螨属 (Oligonychus spp.)、钝缘蜱属 (Ornithodoros spp.)、全爪螨属 (Panonychus spp.)、桔芸锈螨 (Phyllocoptruta oleivora)、侧多食跗线螨 (Polyphagotarsonemus latus)、痒螨属 (Psoroptes spp.)、扇头蜱属 (Rhipicephalus

spp.)、根螨属(Rhizoglyphus spp.)、疥螨属(Sarcoptes spp.)、中东金蝎(Scorpio maurus)、Stenotarsonemus spp.、跗线螨属(Tarsonemus spp.)、叶螨属(Tetranychus spp.)、Vasates lycopersici。

[0255] Bivalva纲,例如,Dreissena spp.。

[0256] 唇足目(Chilopoda),例如,地蜈蚣属(Geophilus spp.)、Scutigera spp.。

[0257] 鞘翅目(Coleoptera),例如,菜豆象(Acanthoscelidesobtectus)、喙丽金龟属(Adoretus spp.)、杨树萤叶甲(Agelasticaalni)、叩甲属(Agriotes spp.)、马铃薯鳃角金龟(Amphimallonsolstitialis)、家具窃蠹(Anobium punctatum)、星天牛属(Anoplophora spp.)、花象属(Anthonomus spp.)、圆皮蠹属(Anthrenus spp.)、阿鳃金龟属(Apogonia spp.)、Atomaria spp.、毛皮蠹属(Attagenus spp.)、恶条豆象(Bruchidius obtectus)、豆象属(Bruchus spp.)、龟象属(Ceuthorhynchus spp.)、Cleonusmendicus、宽胸叩头虫属(Conoderus spp.)、根颈象属(Cosmopolitesspp.)、褐新西兰肋翅鳃角金龟(Costelytra zealandica)、象虫属(Curculio spp.)、杨干隐喙象(Cryptorhynchus lapathi)、皮蠹属(Dermestes spp.)、叶甲属(Diabrotica spp.)、食植瓢虫属(Epilachna spp.)、Faustinus cubae、裸蛛甲(Gibbium psylloides)、黑异爪蔗金龟(Heteronychus arator)、Hylamorpha elegans、北美家天牛(Hylotrupes bajulus)、紫苜蓿叶象(Hypera postica)、Hypothenemus spp.、甘蔗大褐齿爪鳃金龟(Lachnos ternaconsanguinea)、马铃薯甲虫(Leptinotarsa decemlineata)、稻根象(Lissorhoptrus oryzophilus)、筒喙象属(Lixus spp.)、粉蠹属(Lyctus spp.)、油菜花露尾甲(Meligethes aeneus)、西方五月鳃角金龟(Melolontha melolontha)、Migdolus spp.、墨天牛属(Monochamus spp.)、Naupactus xanthographus、黄蛛甲(Niptushololeucus)、椰蛀犀金龟(Oryctes rhinoceros)、锯谷盗(Oryzaephilus surinamensis)、黑葡萄耳象(Otiorrhynchussulcatus)、小青花金龟(Oxycetonia jucunda)、辣根猿叶虫(Phaedoncochleariae)、食叶鳃金龟属(Phyllophaga spp.)、日本弧丽金龟(Popillia japonica)、Premnotrypes spp.、油菜金头跳甲(Psylliodes chrysocephala)、蛛甲属(Ptinus spp.)、暗色瓢虫(Rhizobius ventralis)、谷蠹(Rhizopertha dominica)、谷象属(Sitophilus spp.)、尖隐喙象属(Sphenophorus spp.)、茎干象属(Sternechus spp.)、Symphyletes spp.、黄粉虫(Tenebriomolitor)、拟谷盗属(Tribolium spp.)、斑皮蠹属(Trogoderma spp.)、籽象属(Tychius spp.)、脊虎天牛属(Xylotrechus spp.)、距步甲属(Zabrus spp.)。

[0258] 弹尾目(Collembola),例如,武装棘跳虫(Onychiurus armatus)。

[0259] 革翅目(Dermaptera),例如,欧洲球蝼(Forficula auricularia)。

[0260] 倍足目(Diplopoda),例如,Blaniulus guttulatus。

[0261] 双翅目(Diptera),例如,伊蚊属(Aedes spp.)、按蚊属(Anophelesspp.)、花园毛蚊(Bibio hortulanus)、红头丽蝇(Calliphoraerythrocephala)、地中海蜡实蝇(Ceratitis capitata)、金蝇属(Chrysomyia spp.)、锥蝇属(Cochliomyia spp.)、Cordylobiaanthropophaga、库蚊属(Culex spp.)、黄蝇属(Cuterebra spp.)、橄榄大实蝇(Dacus oleae)、人肤蝇(Dermatobia hominis)、果蝇属(Drosophila spp.)、厕蝇属(Fannia spp.)、胃蝇属(Gastrophilusspp.)、黑蝇属(Hylemyia spp.)、Hyppobosca spp.、皮蝇属(Hypodermaspp.)、斑潜蝇属(Liriomyza spp.)、绿蝇属(Lucilia spp.)、

家蝇属(Musca spp.)、绿蝽属(Nezara spp.)、狂蝇属(Oestrus spp.)、瑞典麦秆蝇(Oscinella frit)、藜泉蝇(Pegomyia hyoscyami)、草种蝇属(Phorbia spp.)、螯蝇属(Stomoxys spp.)、虻属(Tabanusspp.)、Tannia spp.、欧洲大蚊(Tipula paludosa)、污蝇属(Wohlfahrtia spp.)。

[0262] 腹足纲(Gastropoda),例如,Arion spp.、双脐螺属(Biomphalariaspp.)、小泡螺属(Bulinus spp.)、Deroceras spp.、土蜗属(Galbaspp.)、椎实螺属(Lymnaea spp.)、钉螺属(Oncomelania spp.)、琥珀螺属(Succinea spp.)。

[0263] 蠕虫纲(Helminths),例如,十二指肠钩口线虫(Ancylostomaduodenale)、斯里兰卡钩口线虫(Ancylostoma ceylanicum)、巴西钩口线虫(Acylostoma braziliensis)、钩口线虫属(Ancylostoma spp.)、似引蛔线虫(Ascaris lubricoides)、蛔虫属(Ascaris spp.)、马来布鲁线虫(Brugia malayi)、帝汶布鲁线虫(Brugia timori)、仰口线虫属(Bunostomum spp.)、夏柏特线虫属(Chabertia spp.)、枝睾吸虫属(Clonorchis spp.)、古柏线虫属(Cooperia spp.)、双腔吸虫属(Dicrocoelium spp.)、丝状网尾线虫(Dictyocaulus filaria)、阔节裂头绦虫(Diphyllobothrium latum)、麦地那龙线虫(Dracunculus medinensis)、细粒棘球绦虫(Echinococcusgranulosus)、多房棘球绦虫(Echinococcus multilocularis)、蠕形住肠蛲虫(Enterobius vermicularis)、Faciola spp.、血毛线虫属(Haemonchus spp.)、异刺线虫属(Heterakis spp.)、矮小啮壳绦虫(Hymenolepis nana)、猪圆线虫属(Hyostrongulus spp.)、罗阿罗阿线虫(Loa Loa)、细颈线虫属(Nematodirus spp.)、结节线虫属(Oesophagostomum spp.)、后睾吸虫属(Opisthorchis spp.)、旋盘尾丝虫(Onchocerca volvulus)、奥斯脱线虫属(Ostertagia spp.)、并殖吸虫属(Paragonimus spp.)、Schistosomen spp.、富氏类圆线虫(Strongyloides fuelleborni)、粪类圆线虫(Strongyloidesstercoralis)、粪圆线虫属(Stronyloides spp.)、牛带绦虫(Taeniasaginata)、猪带绦虫(Taenia solium)、旋毛形线虫(Trichinellaspiralis)、本地毛形线虫(Trichinella nativa)、株布氏旋毛虫(Trichinella britovi)、南方旋毛虫(Trichinella nelsoni)、Trichinella pseudopsiralis、毛圆线虫属(Trichostrongulus spp.)、Trichuris trichuria、班氏吴策线虫(Wucheretia bancrofti)。

[0264] 此外,也可防治原生动物,例如艾美虫(Eimeria)。

[0265] 异翅目(Heteroptera),例如,南瓜缘蝽(Anasa tristis)、拟丽蝽属(Antestiopsis spp.)、土长蝽属(Blissus spp.)、俊盲蝽属(Calocoris spp.)、Campylomma livida、异背长蝽属(Caveleriusspp.)、臭虫属(Cimex spp.)、Creontiades dilutus、胡椒缘蝽(Dasynuspiperis)、Dichelops furcatus、厚氏长棒网蝽(Diconocorishewetti)、棉红蝽属(Dysdercus spp.)、美洲蝽属(Euschistus spp.)、扁盾蝽属(Eurygaster spp.)、Heliopeltis spp.、Horciasnobilellus、稻缘蝽属(Leptocorisa spp.)、叶喙缘蝽(Leptoglossusphyllopus)、草盲蝽属(Lygus spp.)、蔗黑长蝽(Macropes excavatus)、盲蝽科(Miridae)、绿蝽属、Oebalus spp.、Pentomidae、方背皮蝽(Piesma quadrata)、壁蝽属(Piezodorus spp.)、棉伪斑腿盲蝽(Psallus seriatus)、Pseudacysta persea、红猎蝽属(Rhodniusspp.)、可可褐盲蝽(Sahlbergella singularis)、黑蝽属(Scotinophora spp.)、梨冠网蝽(Stephanitis nashi)、Tibracaspp.、锥猎蝽属(Triatoma

spp.)。

[0266] 同翅目(Homoptera),例如,无网长管蚜属(Acyrthosipon spp.)、Aeneolamia spp.、隆脉木虱属(Agonoscena spp.)、Aleurodes spp.、蔗粉虱属(Aleurolobus barodensis)、Aleurothrixus spp.、杧果叶蝉属(Amrasca spp.)、Anuraphis cardui、肾圆盾蚧属(Aonidiellaspp.)、苏联黄粉蚜(Aphanostigma piri)、蚜属(Aphis spp)、葡萄叶蝉(Arboridia apicalis)、小圆盾蚧属(Aspidiella spp.)、圆盾蚧属(Aspidiotus spp.)、Atanus spp.、茄沟无网蚜(Aulacorthumsolani)、Bemisia spp.、李短尾蚜(Brachycaudus helichrysii)、Brachycolus spp.、甘蓝蚜(Brevicoryne brassicae)、小褐稻虱(Calligyponama rginata)、Carneocephala fulgida、甘蔗粉角蚜(Ceratovacuna lanigera)、沫蝉科(Cercopidae)、蜡蚧属(Ceroplastes spp.)、草莓钉蚜(Chaetosiphon fragaefolii)、蔗黄雪盾蚧(Chionaspis tegalensis)、茶绿叶蝉(Chloritaonukii)、核桃黑斑蚜(Chromaphis juglandicola)、黑褐圆盾蚧(Chrysomphalusficus)、玉米叶蝉(Cicadulina mbila)、Coccomytilus halli、软蚧属(Coccus spp.)、茶蔗隐瘤蚜(Cryptomyzus ribis)、Dalbulusspp.、Dialeurodes spp.、Diaphorina spp.、白背盾蚧属(Diaspisspp.)、Doralis spp.、履绵蚧属(Drosicha spp.)、西圆尾蚜属(Dysaphis spp.)、灰粉蚧属(Dysmicoccus spp.)、小绿叶蝉属(Empoasca spp.)、绵蚜属(Eriosoma spp.)、Erythroneura spp.、Euscelis bilobatus、咖啡地粉蚧(Geococcus coffeae)、假桃病毒叶蝉(Homalodisca coagulata)、梅大尾蚜(Hyalopterus arundinis)、吹绵蚧属(Icerya spp.)、片角叶蝉属(Idiocerus spp.)、扁喙叶蝉属(Idioscopus spp.)、灰飞虱(Laodelphax striatellus)、Lecaniumspp.、蛎盾蚧属(Lepidosaphes spp.)、萝卜蚜(Lipaphis erysimi)、长管蚜属(Macrosiphum spp.)、Mahanarva fimbriolata、高粱蚜(Melanaphis sacchari)、Metcalfiella spp.、麦无网蚜(Metopolophium dirhodum)、黑缘平翅斑蚜(Monellia costalis)、Monelliopsis pecanis、瘤蚜属(Myzus spp.)、莴苣衲长管蚜(Nasonovia ribisnigri)、黑尾叶蝉属(Nephotettix spp.)、褐飞虱(Nilaparvata lugens)、Oncometopia spp.、Orthezia praelonga、杨梅缘粉虱(Parabemisia myricae)、Paratrioza spp.、片盾蚧属(Parlatoria spp.)、瘿绵蚜属(Pemphigus spp.)、玉米蜡蝉(Peregrinus maidis)、绵粉蚧属(Phenacoccus spp.)、杨平翅绵蚜(Phloeomyzus passerinii)、忽布疣蚜(Phorodon humuli)、Phylloxera spp.、苏铁褐点并盾蚧(Pinnaspis aspidistrae)、臀纹粉蚧属(Planococcus spp.)、梨形原绵蚧(Protopulvinariapyriformis)、桑白盾蚧(Pseudaulacas pispentagona)、粉蚧属(Pseudococcus spp.)、木虱属(Psylla spp.)、金小蜂属(Pteromalusspp.)、Pyrilla spp.、笠圆盾蚧属(Quadraspidiotus spp.)、Quesadagigas、平刺粉蚧属(Rastrococcus spp.)、缢管蚜属(Rhopalosiphumspp.)、黑盔蚧属(Saissetia spp.)、Scaphoides titanus、麦二叉蚜(Schizaphis graminum)、苏铁刺圆盾蚧(Selenaspidusarticulatus)、长唇基飞虱属(Sogata spp.)、白背飞虱(Sogatellafurcifera)、Sogatodes spp.、Stictocephala festina、Tenalapharamalayensis、Tinocallis caryaefoliae、广胸沫蝉属(Tomaspis spp.)、声蚜属(Toxoptera spp.)、温室粉虱(Trialeurodes vaporariorum)、个木虱属(Trioza spp.)、小叶蝉属(Typhlocyba spp.)、尖盾蚧属(Unaspis spp.)、Viteus vitifolii。

[0267] 膜翅目(Hymenoptera),例如,松叶蜂属(Diprion spp.)、实叶蜂属(Hoplocampa spp.)、毛蚁属(Lasius spp.)、小家蚁(Monomor iumpharaonis)、胡蜂属(Vespa spp.)。

[0268] 等足目(Isopoda),例如,鼠妇(Armadillidium vulgare)、栉水虱(Oniscus asellus)、球鼠妇(Porcellio scaber)。

[0269] 等翅目(Isoptera),例如,散白蚁属(Reticulitermes spp.)、土白蚁属(Odontotermes spp.)。

[0270] 鳞翅目(Lepidoptera),例如,桑剑纹夜蛾(Acronicta major)、烦夜蛾(Aedia leucome las)、地老虎属(Agrotis spp.)、棉叶波纹夜蛾(Alabama argillacea)、干煞夜蛾属(Anticarsia spp.)、Barathrabrassicae、棉潜蛾(Bucculatrix thurberiella)、松尺蠖(Bupaluspiniarius)、亚麻黄卷蛾(Cacoecia podana)、Capua reticulana、苹果小卷蛾(Carpocapsa pomonella)、冬尺蛾(Cheimatobia brumata)、禾草螟属(Chilo spp.)、枞色卷蛾(Choristoneura fumiferana)、葡萄果蠹蛾(Clysia ambiguella)、Cnaphalocerus spp.、埃及金刚钻(Earias insulana)、地中海粉斑螟(Ephestia kuehniella)、黄毒蛾(Euproctis chrysorrhoea)、切根虫属(Euxoa spp.)、脏切夜蛾属(Feltia spp.)、大蜡螟(Galleria mellonella)、Helicoverpaspp.、实夜蛾属(Heliothi sspp.)、褐织蛾(Hofmannophilapseudospretella)、茶长卷蛾(Homona magnanima)、苹果巢蛾(Hyponomeuta padella)、贪夜蛾属(Laphygma spp.)、苹细蛾(Lithocolletis blancardella)、绿果冬夜蛾(Lithophaneantennata)、豆白隆切根虫(Loxagrotis albicosta)、毒蛾属(Lymantria spp.)、黄褐天幕毛虫(Malacosoma neustria)、甘蓝夜蛾(Mamestra brassicae)、稻毛胫夜蛾(Mocis repanda)、粘虫(Mythimma separata)、Oria spp.、水稻负泥虫(Oulema oryzae)、小眼夜蛾(Panolis flammea)、红铃麦蛾(Pectinophora gossypiella)、桔潜蛾(Phyllocnistis citrella)、菜粉蝶属(Pieris spp.)、菜蛾(Plutellaxylostella)、斜纹夜蛾属(Prodenia spp.)、Pseudaletiaspp.、大豆夜蛾(Pseudoplusia includens)、玉米螟(Pyraustanubilalis)、灰翅夜蛾属(Spodoptera spp.)、Thermesia gemmatalis、袋谷蛾(Tinea pellionella)、幕谷蛾(Tineola bisselliella)、栎绿卷蛾(Tortrix viridana)、粉夜蛾属(Trichoplusia spp.)。

[0271] 直翅目(Orthoptera),例如,家蟋(Acheta domesticus)、东方蜚蠊(Blatta orientalis)、德国蠊(Blattella germanica)、蝼蛄属(Gryllotalpa spp.)、马德拉蜚蠊(Leucophaea maderae)、飞蝗属(Locusta spp.)、黑蝗属(Melanoplus spp.)、美洲大蠊(Periplanetaamericana)、沙漠蝗(Schistocerca gregaria)。

[0272] 蚤目(Siphonaptera),例如,角叶蚤属(Ceratophyllu sspp.)、印鼠客蚤(Xenopsylla cheopis)。

[0273] 综合目(Symphyla),例如,Scutigerella immaculata。

[0274] 缨翅目(Thysanoptera),例如,稻蓟马(Baliothrips biformis)、Enneothrips flavens、花蓟马属(Frankliniella spp.)、网蓟马属(Heliothrips spp.)、温室条篱蓟马(Hercinothrips femoralis)、卡蓟马属(Kakothrips spp.)、葡萄蓟马(Rhipiphorothripscruentatus)、硬蓟马属(Scirtothrips spp.)、Taeniothripscardamoni、蓟马属(Thrips spp.)。

[0275] 缨尾目(Thysanura),例如,衣鱼(Lepismas accharina)。

[0276] 植物寄生线虫包括，例如，鳗线虫属(Anguina spp.)、滑刃线虫属(Aphelenchoides spp.)、刺线虫属(Belonoaimus spp.)、伞滑刃线虫属(Bursaphelenchus spp.)、起绒草茎线虫(Ditylenchusdipsaci)、球异皮线虫属(Globodera spp.)、螺旋线虫属(Heliocotylenchus spp.)、异皮线虫属(Heterodera spp.)、长针线虫属(Longidorus spp.)、根结线虫属(Meloidogyne spp.)、短体线虫属(Pratylenchus spp.)、相似穿孔线虫(Radopholussimilis)、小盘旋线虫属(Rotylenchus spp.)、毛刺线虫属(Trichodorus spp.)、矮化线虫属(Tylenchorhynchus spp.)、小垫刃线虫属(Tylenchulus spp.)、半穿刺线虫(Tylenchulussemipenetrans)、剑线虫属(Xiphinema spp.)。

[0277] 如果合适，本发明化合物也可以一定浓度或施用率用作除草剂、安全剂、生长调节剂或改善植物特性的药剂，或用作杀微生物剂，例如杀真菌剂、抗霉菌剂、杀细菌剂、杀病毒剂（包括抵抗类病毒的药剂）或用作抵抗 MLO（支原体样生物）和 RLO（立克次体样生物）的药剂。如果合适，它们也可被用作合成其他活性化合物的中间体或前体。

[0278] 本发明活性化合物可转化为常规制剂，例如溶液剂、乳剂、可湿性粉剂、水基和油基悬浮剂、粉剂、粉末剂、膏剂、可溶性粉剂、可溶性颗粒剂、撒播颗粒剂、悬乳浓缩剂、经活性化合物浸渍的天然材料、经活性化合物浸渍的合成材料，肥料，以及聚合物中的微胶囊剂。

[0279] 这些制剂以已知方式制备，例如将活性化合物与填充剂混合，即与液体溶剂和 / 或固体载体混合，任选使用表面活性剂，即乳化剂和 / 或分散剂和 / 或发泡剂。这些制剂既可在适合的工厂中制备或也可在施用之前或使用过程中制备。

[0280] 适宜用作助剂的为适于将特定特性例如某些工艺特性和 / 或特定的生物特性赋予组合物本身和 / 或由其制得的制剂（例如喷雾液剂、种子包衣剂）的物质。通常的适宜助剂为：填充剂、溶剂和载体。

[0281] 适宜的填充剂为，例如水、极性和非极性有机化学液体，例如芳烃和非芳烃类（例如石蜡、烷基苯、烷基萘、氯苯）、醇和多元醇（如果合适，其还可被取代、醚化和 / 或酯化）、酮（例如丙酮、环己酮）、酯（包括脂肪和油）以及（聚）醚，未被取代的和被取代的胺、酰胺、内酰胺（例如 N- 烷基吡咯烷酮）以及内酯、砜和亚砜（例如二甲亚砜）。

[0282] 如果所用填充剂为水，还可使用例如有机溶剂作为助溶剂。适宜的液体溶剂主要有：芳族化合物，例如二甲苯、甲苯或烷基萘；氯代芳族化合物和氯代脂族烃，例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷；脂族烃，例如环己烷或石蜡，如石油馏分、矿物油和植物油；醇，例如丁醇或乙二醇，及其醚和酯；酮，例如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮；强极性溶剂，例如二甲基亚砜；以及水。

[0283] 适宜的固体载体有：

[0284] 例如铵盐，和粉碎的天然矿物如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、凹凸棒石、蒙脱石或硅藻土，及粉碎的合成矿物如细碎的二氧化硅、氧化铝和硅酸盐；适用于颗粒剂的固体载体有：例如粉碎并分级的天然岩石，例如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石；及合成的无机及有机粉颗粒；及有机物颗粒，例如纸、锯屑、椰壳、玉米穗轴和烟草茎；适宜的乳化剂和 / 或发泡剂有：例如非离子及阴离子乳化剂，例如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚，如烷基芳基聚乙二醇醚，烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐，以及蛋白质水解产物；适宜的分散剂有非离子物质和 / 或离子物质，例如醇 -POE 醚和 / 或醇 -POP 醚类、酸和 / 或

POP-POE 酯、烷基芳基和 / 或 POP-POE 醚、脂肪和 / 或 POP-POE 加合物、POE- 和 / 或 POP- 多元醇衍生物、POE- 和 / 或 POP- 脱水山梨糖醇加合物或 POE- 和 / 或 POP- 蔗糖加合物、烷基或芳基硫酸酯、烷基或芳基磺酸酯，及烷基或芳基磷酸酯，或者相应的 PO- 醚加合物。此外适宜的低聚物或聚合物，例如由乙烯单体、丙烯酸、EO 和 / 或 PO 单独地或与例如（多元）醇或（多）胺相结合而得到的低聚物或聚合物。也可使用木质素及其磺酸衍生物、未经改性的和改性的纤维素、芳族和 / 或脂族磺酸以及它们与甲醛的加合物。

[0285] 制剂中可使用增粘剂，例如羧甲基纤维素，和粉末、颗粒或胶乳形式的天然及合成聚合物，例如阿拉伯树胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯；及天然磷脂，例如脑磷脂和卵磷脂，及合成磷脂。

[0286] 可使用着色剂，例如无机颜料，如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝；及有机染料，例如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料；及微量营养物质，例如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐。

[0287] 其他可行的添加剂有香料、任选经改性的矿物油或植物油、蜡和营养物质（包括微量营养物质），例如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐。

[0288] 还可存在稳定剂，例如低温稳定剂、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂或其他改进化学和 / 或物理稳定性的试剂。

[0289] 制剂通常含有 0.01 和 98 重量%之间的活性化合物，优选 0.5 和 90%之间。

[0290] 本发明活性化合物可以其市售制剂、和由所述制剂制备的使用形式与其他活性化合物混合而使用，所述其他活性化合物例如杀昆虫剂、引诱剂、消毒剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、生长调节剂、除草剂、安全剂、肥料或化学信息素。

[0291] 特别有利的混合组分为例如以下化合物：

[0292] 杀真菌剂：

[0293] 核酸合成抑制剂

[0294] 苯霜灵 (benalaxyl)、精苯霜灵 (benalaxyl-M)、乙嘧酚磺酸酯 (bupirimate)、chiralaxyl、clozylacon、二甲嘧酚 (dimethirimol)、乙嘧酚 (ethirimol)、呋霜灵 (furalaxyl)、恶霉灵 (hymexazol)、甲霜灵 (metalaxyl)、高效霜灵 (metalaxyl-M)、呋酰胺 (ofurace)、噁霜灵 (oxadixyl)、喹菌酮 (oxolinica cid)

[0295] 有丝分裂和细胞分裂抑制剂

[0296] 苯菌灵 (benomyl)、多菌灵 (carbendazim)、乙霉威 (diethofencarb)、麦穗宁 (fuberidazole)、戊菌隆 (pencycuron)、噻菌灵 (thiabendazole)、甲基硫菌灵 (thiophanat-methyl)、苯酰菌胺 (zoxamide)

[0297] 呼吸链复合物 I 的抑制剂

[0298] 氟嘧菌胺 (diflumetorim)

[0299] 呼吸链复合物 II 的抑制剂

[0300] 啶酰菌胺 (boscalid)、萎锈灵 (carboxin)、甲呋酰胺 (fenfuram)、氟酰胺 (flutolanil)、呋吡菌胺 (furametpyr)、灭锈胺 (mepronil)、氧化萎锈灵 (oxycarboxin)、吡噻菌胺 (penthiopyrad)、溴氟唑菌 (thifluzamide)

[0301] 呼吸链复合物 III 的抑制剂

[0302] 嘧菌酯 (azoxystrobin)、氰霜唑 (cyazofamid)、醚菌胺 (dimoxystrobin)、

enestrobin、噁唑菌酮(famoxadone)、咪唑菌酮(fenamidone)、氟嘧菌酯(fluoxastrobin)、醚菌酯(kresoxim-methyl)、苯氧菌胺(metominostrobin)、肟醚菌胺(orysastrobin)、唑菌胺酯(pyraclostrobin)、啶氧菌酯(picoxystrobin)

[0303] 解偶剂

[0304] 敌螨普(dinocap)、氟啶胺(fluazinam)

[0305] ATP产生抑制剂

[0306] 三苯基乙酸锡(fentin acetate)、三苯基氯化锡(fentinchloride)、毒菌锡(fentin hydroxide)、硅噻菌胺(silthiofam)氨基酸生物合成抑制剂和蛋白质生物合成抑制剂

[0307] 胺扑灭(andoprim)、灭瘟素(blasticidin-S)、嘧菌环胺(cyprodinil)、春雷霉素(kasugamycin)、春雷霉素一水合盐酸盐(kasugamycin hydrochloride hydrate)、嘧菌胺(mepanipyrim)、嘧霉胺(pyrimethanil)

[0308] 信号转导抑制剂

[0309] 拌种咯(fenpiclonil)、咯菌腈(fludioxonil)、苯氧喹啉(quinoxyfen)

[0310] 脂类和膜合成抑制剂

[0311] 乙菌利(chlozolinate)、异菌脲(iprodione)、腐霉利(procymidone)、乙烯菌核利(vinclozolin)

[0312] 氨丙膦酸(ampropylfos)、potassium-ampropylfos、敌瘟磷(edifenphos)、异稻瘟净(iprobenfos)(IBP)、稻瘟灵(isoprothiolane)、吡菌磷(pyrazophos)

[0313] 甲基立枯磷(tolclofos-methyl)、联苯

[0314] iodocarb、霜霉威(propamocarb)、霜霉威盐酸盐(propamocarbhydrochloride)

[0315] 麦角固醇生物合成抑制剂

[0316] 环酰菌胺(fenhexamid)，

[0317] 氧环唑(azaconazole)、双苯三唑醇(bitertanol)、糠菌唑(bromuconazole)、环唑醇(cyproconazole)、苄氯三唑醇(diclobutrazole)、苯醚甲环唑(difenoconazole)、烯唑醇(diniconazole)、达克利(diniconazole-M)、氟环唑(epoxiconazole)、乙环唑(etaconazole)、腈苯唑(fenbuconazole)、氟喹唑(fluquinconazole)、氟硅唑(flusilazole)、粉唑醇(flutriafol)、呋菌唑(furconazole)、呋醚唑(furconazole-cis)、己唑醇(hexaconazole)、亚胺唑(imibenconazole)、种菌唑(ipconazole)、叶菌唑(metconazole)、腈菌唑(myclobutanil)、多效唑(paclobutrazole)、戊菌唑(penconazole)、丙环唑(propiconazole)、丙硫菌唑(prothioconazole)、硅氟唑(simeconazole)、戊唑醇(tebuconazole)、四氟醚唑(tetraconazole)、三唑酮(triadimefon)、唑菌醇(triadimenol)、灭菌唑(triticonazole)、烯效唑(uniconazole)、伏立康唑(voriconazole)、抑霉唑(imazalil)、烯菌灵(imazalil sulphate)、恶咪唑(oxpoconazole)、氯苯嘧啶醇(fenarimol)、呋嘧醇(flurprimidole)、氟苯嘧啶醇(nuarimol)、啶斑肟(pyrifenox)、嗪氨灵(triforine)、稻瘟酯(pefurazoate)、咪鲜胺(prochloraz)、氟菌唑(triflumizole)、烯霜苄唑(viniconazole)

[0318] aldimorph、十二环吗啉(dodemorph)、十二环吗啉乙酸盐(dodemorph acetate)、

丁苯吗啉 (fenpropimorph)、十三吗啉 (tridemorph)、苯锈啶 (fenpropidin)、螺环菌胺 (spiroxamine)，

[0319] 萘替芬 (naftifine)、稗草丹 (pyributicarb)、特比萘芬 (terbinafine)

[0320] 细胞壁合成抑制剂

[0321] 苯噻菌胺 (benthiavalicarb)、双丙氨膦 (bialaphos)、烯酰吗啉 (dimethomorph)、氟吗啉 (flumorph)、异丙菌胺 (iprovalicarb)、多抗霉素 (polyoxins)、多氧霉素 (polyoxorim)、有效霉素 A(validamycin A)

[0322] 黑色素生物合成抑制剂

[0323] 环丙酰菌胺 (capropamid)、双氯氰菌胺 (diclocymet)、氰菌胺 (fenoxanil)、四氯苯酞 (phthalid)、咯喹酮 (pyroquilon)、三环唑 (tricyclazole)

[0324] 抗性诱导剂

[0325] 苯并噻二唑 (acibenzolar-S-methyl)、烯丙苯噻唑 (probenazole)、噻酰菌胺 (tiadinil)

[0326] 多位点化合物

[0327] 敌菌丹 (captafol)、克菌丹 (captan)、百菌清 (chlorothalonil)、铜盐例如：氢氧化铜、环烷酸铜、氯氧化铜 (copper oxychloride)、硫酸铜、一氧化铜、喹啉铜 (oxine-copper) 和波尔多液、苯氟磺胺 (dichlofluanid)、二氰蒽醌 (dithianon)、多果定 (dodine)、多果定游离碱 (dodine free base)、福美铁 (ferbam)、灭菌丹 (folpet)、氟灭菌丹 (fluorofolpet)、双胍辛盐 (guazatine)、双胍辛乙酸盐 (guazatine acetate)、双胍辛胺 (iminoctadine)、双胍辛烷基苯磺酸盐 (iminoctadine albesilate)、双胍辛胺乙酸盐 (iminoctadinetriacetate)、代森锰铜 (mancopper)、代森锰锌 (mancozeb)、代森锰 (maneb)、代森联 (metiram)、代森联锌 (metiram zinc)、丙森锌 (propineb)、硫及硫制剂包括多硫化钙、福美双 (thiram)、甲苯氟磺胺 (tolylfluanid)、代森锌 (zineb)、福美锌 (ziram)

[0328] 未知机理化合物

[0329] amibromdol、苯噻硫氰 (benthiazol)、bethoxazin、卡巴西霉素 (capsimycin)、香芹酮 (carvone)、灭螨猛 (chinomethionat)、氯化苦 (chloropicrin)、硫杂灵 (cufraneb)、环氟菌胺 (cyflufenamid)、霜脲氰 (cymoxanil)、棉隆 (dazomet)、咪菌威 (debacarb)、哒菌酮 (diclomezine)、双氯酚 (dichlorophen)、氯硝胺 (dicloran)、野燕枯 (difenzoquat)、野燕枯甲基硫酸酯 (difenzoquat methyl sulphate)、二苯胺 (diphenylamine)、韩乐宁 (ethaboxam)、嘧菌腙 (ferimzone)、氟酰菌胺 (flumetover)、磺菌胺 (flusulfamide)、氟啶酰菌胺 (fluopicolide)、氟氯菌核利 (fluoroimide)、六氯苯 (hexachlorobenzene)、8-羟基喹啉硫酸盐、人间霉素 (irumamycin)、磺菌威 (methasulphocarb)、苯菌酮 (metrafenone)、异硫氰酸甲酯 (methyl isothiocyanate)、米多霉素 (mildiomycin)、多马霉素 (natamycin)、福美镍 (nickel dimethyldithiocarbamate)、酞菌酯 (nitrothal-isopropyl)、辛噻酮 (octhilinone)、oxamocarb、oxyfenthiin、五氯苯酚 (pentachlorophenol) 及其盐、2-苯基苯酚及其盐、病花灵 (piperalin)、propanosine-sodium、丙氧喹啉 (proquinazid)、硝吡咯菌素 (pyrrol nitrin)、五氯硝基苯 (quintozene)、叶枯酞 (tecloftalam)、四氯硝基苯 (tecnazene)、咪唑嗪 (triazoxide)、

水杨菌胺(trichlamide)、氰菌胺(zarilamid)及2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺酰基)吡啶、N-(4-氯-2-硝基苯基)-N-乙基-4-甲基苯磺酰胺、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-茚-4-基)-3-吡啶甲酰胺、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基异噁唑烷-3-基]吡啶、顺-1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)环庚醇、2,4-二氢-5-甲氧基-2-甲基-4-[[[[1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]氨基]氧基]甲基]苯基]-3H-1,2,3-三唑-3-酮(185336-79-2)、1-(2,3-二氢-2,2-二甲基-1H-茚-1-基)-1H-咪唑-5-羧酸甲酯、3,4,5-三氯-2,6-吡啶二腈、2-[[[环丙基[(4-甲氧基苯基)亚氨基]甲基]硫基]甲基]-α-(甲氧基亚甲基)苯乙酸甲酯、4-氯-α-丙炔氧基-N-[2-[3-甲氧基-4-(2-丙炔氧基)苯基]乙基]苯乙酰胺、(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、5-氯-7-(4-甲基哌啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶、5-氯-6-(2,4,6-三氟苯基)-N-[(1R)-1,2,2-三甲基丙基][1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-7-胺、5-氯-N-[(1R)-1,2-二甲基丙基]-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-7-胺、N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯烟酰胺、N-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)甲基-2,4-二氯烟酰胺、2-丁氧基-6-碘-3-丙基苯并吡喃-4-酮、N-{(Z)-[(环丙基甲氧基)亚氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苯乙酰胺、N-(3-乙基-3,5,5-三甲基环己基)-3-甲酰基氨基-2-羟基苯甲酰胺、2-[[[[1-[3-(1-氟-2-苯基乙基)氧基]苯基]亚乙基]氨基]氧基]甲基]-α-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-αE-苯乙酰胺、N-{2-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]乙基}-2-(三氟甲基)苯甲酰胺、N-(3′,4′-二氯-5-氟联苯基-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、N-(6-甲氧基-3-吡啶基)环丙烷甲酰胺、1-[(4-甲氧基苯氧基)甲基]-2,2-二甲基丙基-1H-咪唑-1-羧酸、O-[1-[(4-甲氧基苯氧基)甲基]-2,2-二甲基丙基]-1H-咪唑-1-硫代羟酸、2-(2-{[6-(3-氯-2-甲基苯氧基)-5-氟嘧啶-4-基]氧基}苯基)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺

[0330] 杀细菌剂：

[0331] 溴硝丙二醇(bronopol)、双氯酚、三氯甲基吡啶(nitrapyrin)、福镁镍(nickel dimethyldithiocarbamate)、春雷霉素、辛噻酮(octhilinone)、羧酸呋喃(furancarboxylic acid)、土霉素(oxytetracycline)、噻菌灵、链霉素(streptomycin)、叶枯酞、硫酸铜及其他铜制剂。

[0332] 杀昆虫剂/杀螨剂/杀线虫剂：

[0333] 乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂

[0334] 氨基甲酸酯类

[0335] 例如，棉铃威(alanycarb)、涕灭威(aldicarb)、涕灭砜威(aldoxycarb)、除害威(allyxycarb)、灭害威(aminocarb)、噁虫威(bendiocarb)、丙硫克百威(benfuracarb)、必克虱(bufencarb)、畜虫威(butacarb)、丁酮威(butocarboxim)、丁酮砜威(butoxycarboxim)、甲萘威(carbaryl)、克百威(carbofuran)、丁硫克百威(carbosulphan)、除线威(cloethocarb)、敌蝇威(dimetilan)、乙硫苯威(ethiofencarb)、丁苯威(fenobucarb)、苯硫威(fenothiocarb)、伐虫脒(formetanate)、呋线威(furathiocarb)、异丙威(isoprocarb)、威百亩(metam-sodium)、甲硫威(methiocarb)、

灭多威(methomyl)、速灭威(metolcarb)、杀线威(oxamyl)、抗蚜威(pirimicarb)、猛杀威(promecarb)、残杀威(propoxur)、硫双威(thiodicarb)、久效威(thiofanox)、混杀威(trimethacarb)、XMC、灭杀威(xylylcarb)、唑蚜威(triazamate)

[0336] 有机磷酸酯类

[0337] 例如，乙酰甲胺磷(acephate)、甲基吡恶磷(azamethiphos)、谷硫磷(azinphos-methyl)、乙基谷硫磷(azinphos-ethyl)、乙基溴硫磷(bromophos-ethyl)、溴苯烯磷(bromfenvinfos(-methyl))、特嘧硫磷(butathiofos)、硫线磷(cadusafos)、三硫磷(carbophenothion)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、毒虫畏(chlorfenvinphos)、氯甲硫磷(chlormephos)、甲基毒死蜱(chlorpyrifos-methyl)、乙基毒死蜱、蝇毒磷(coumaphos)、苯腈磷(cyanofenphos)、杀螟腈(cyanophos)、毒虫畏(chlorfenvinphos)、甲基内吸磷(demeton-S-methyl)、砜吸磷(demeton-S-methylsulphone)、氯亚胺硫磷(dialifos)、二嗪农(diazinon)、除线磷(dichlofenthion)、敌敌畏(dichlorvos/DDVP)、百治磷(dicrotophos)、乐果(dimethoate)、甲基毒虫畏(dimethylvinphos)、蔬果磷(dioxabenzofos)、乙拌磷(disulphoton)、苯硫磷(EPN)、乙硫磷(ethion)、灭线磷(ethoprophos)、乙嘧硫磷(etrimfos)、伐灭磷(famphur)、苯线磷(fenamiphos)、杀螟硫磷(fenitrothion)、丰索磷(fensulfothion)、倍硫磷(fenthion)、吡氟硫磷(flupyrazofos)、地虫硫磷(fonofos)、安硫磷(formothion)、丁苯硫磷(fosmethilan)、噻唑磷(fosthiazate)、庚烯磷(heptenophos)、碘硫磷(iodofenphos)、异稻瘟净(iprobenfos)、氯唑磷(isazofos)、异柳磷(isofenphos)、O-水杨酸异丙酯、噁唑啉(isoxathion)、马拉硫磷(malathion)、灭蚜磷(mecarbam)、虫螨畏(methacrifos)、甲胺磷(methamidophos)、杀扑磷(methidathion)、速灭磷(mevinphos)、久效磷(monocrotophos)、二溴磷(naled)、氧化乐果(omethoate)、亚砜磷(oxydemeton-methyl)、甲基对硫磷(parathion-methyl)、对硫磷(parathion-ethyl)、稻丰散(phenthoate)、甲拌磷(phorate)、伏杀硫磷(phosalone)、亚胺硫磷(phosmet)、磷胺(phosphamidon)、乙丙磷威(phosphocarb)、腈肟磷(phoxim)、虫螨磷(pirimiphos-methyl)、乙基虫螨磷(pirimiphos-ethyl)、丙溴磷(profenofos)、丙虫磷(propaphos)、胺丙畏(propetamphos)、丙硫磷(prothiofos)、发硫磷(prothoate)、吡唑硫磷(pyraclofos)、哒嗪硫磷(pyridaphenthion)、pyridathion、喹硫磷(quinalphos)、硫线磷(sebufos)、治螟磷(sulphotep)、硫丙磷(sulprofos)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、双硫磷(temephos)、特丁硫磷(terbufos)、杀虫畏(tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷(thiometon)、三唑磷(triazophos)、敌百虫(triclorfon)、蚜灭磷(vamidothion)

[0338] 钠通道调节剂/电压依赖性(voltage-dependent)钠通道阻断剂

[0339] 拟除虫菊酯类，

[0340] 例如，氟丙菊酯(acrinathrin)、烯丙菊酯(d-顺-反，d-反)(allethrin(d-cis-trans，d-trans))、高效氟氯氰菊酯(beta-cyfluthrin)、联苯菊酯(bifenthrin)、生物烯丙菊酯(bioallethrin)、生物烯丙菊酯-S-环戊基异构体、bioethanomethrin、生物氯菊酯(biopermethrin)、生物苄呋菊酯(bioresmethrin)、chlovaporthrin、顺-氯氰菊酯、顺-苄呋菊酯(cis-resmethrin)、顺-氯菊酯(cis-permethrin)、功夫菊酯(clocythrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、氟氯氰

菊酯(cyfluthrin)、氯氟氰菊酯(cyhalothrin)、氯氰菊酯(α-、β-、θ-、ζ-)(cypermethrin(alpha-,beta-,theta-,zeta-))、苯醚氰菊酯(cyphenothrin)、溴氰菊酯(deltamethrin)、右旋烯炔菊酯(1R异构体)(empenthrin(1R isomer))、S-氰戊菊酯(esfenvalerate)、醚菊酯(etofenprox)、五氟苯菊酯(fenfluthrin)、甲氰菊酯(fenpropathrin)、吡氯氰菊酯(fenpyrithrin)、氰戊菊酯(fenvalerate)、溴氟菊酯(flubrocythrinate)、氟氰戊菊酯(flucythrinate)、三氟醚菊酯(flufenprox)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、氟胺氰菊酯(fluvalinate)、fubfenprox、γ-氯氟氰菊酯(gamma-cyhalothrin)、咪炔菊酯(imiprothrin)、噻嗯菊酯(kadethrin)、高效氯氟氰菊酯(lambda-cyhalothrin)、甲氧苄氟菊酯(metofluthrin)、氯菊酯(顺-、反-)、苯醚菊酯(1R反式异构体)(phenothrin(1R trans-isomer)、右旋炔丙菊酯(prallethrin)、丙氟菊酯(profluthrin)、protrifenbute、反灭虫菊(pyresmethrin)、苄呋菊酯、噻嗯菊酯(RU-15525)、氟硅菊酯(silafluofen)、氟胺氰菊酯(tau-fluvalinate)、七氟菊酯(tefluthrin)、环戊烯丙菊酯(terallethrin)、胺菊酯(1R异构体)(tetramethrin(1R isomer))、四溴菊酯(tralomethrin)、四氟苯菊酯(transfluthrin)、溴氟菊酯(ZXI8901)、除虫菊素(pyrethrins)(除虫菊(pyrethrum))

[0341] DDT

[0342] 噁二嗪类(oxadiazines),

[0343] 例如噁二唑虫(indoxacarb)

[0344] 缩氨基脲类,

[0345] 例如metaflumizone(BAS3201)

[0346] 乙酰胆碱受体激动剂/拮抗剂

[0347] 氯烟碱基类(chloronicotinyls),

[0348] 例如,吡虫清(acetamiprid)、噻虫胺(clothianidin)、呋虫胺(dinotefuran)、吡虫啉(imidacloprid)、烯啶虫胺(nitenpyram)、硝虫噻嗪(nithiazine)、噻虫啉(thiacloprid)、imidaclothiz、AKD-1022、噻虫嗪(thiamethoxam)

[0349] 烟碱(nicotine)、杀虫磺(bensultap)、巴丹(cartap)

[0350] 乙酰胆碱受体调节剂

[0351] 多杀霉素类(spinosyns),

[0352] 例如多杀菌素(spinosad)、spinetoram(XDE-175)

[0353] GABA门控性氯通道拮抗剂

[0354] 有机氯类,

[0355] 例如,毒杀芬(camphechlor)、氯丹(chlordane)、硫丹(endosulphan)、林丹(gamma-HCH)、六六六(HCH)、七氯(heptachlor)、林丹(lindane)、甲氧滴滴涕(methoxychlor)

[0356] fiprol类,

[0357] 例如,乙酰虫腈(acetoprole)、乙虫腈(ethiprole)、氟虫腈(fipronil)、pyrafluprole、pyriprole、氟吡唑虫(vaniliprole)

[0358] 氯通道激活剂类

[0359] Mectin类,

[0360] 例如，阿维菌素 (abamectin)、埃玛菌素 (emamectin)、埃玛菌素苯甲酸盐 (emamectinbenzoate)、齐墩螨素 (ivermectin)、lepimectin、米尔倍霉素 (milbemycin)

[0361] 保幼激素模拟物 (mimetic) 类，

[0362] 例如，苯虫醚 (diofenolan)、保幼醚 (epofenonane)、苯氧威 (fenoxycarb)、烯虫乙酯 (hydroprene)、烯虫炔酯 (kinoprene)、烯虫酯 (methoprene)、吡丙醚 (pyriproxifen)、烯虫硫酯 (triprene)

[0363] 蜕皮激素激动剂 / 干扰剂类，

[0364] 二酰基肼类，

[0365] 例如，环虫酰肼 (chromafenozide)、氯虫酰肼 (halofenozide)、甲氧虫酰肼 (methoxyfenozide)、虫酰肼 (tebufenozide)

[0366] 几丁质生物合成抑制剂类

[0367] 苯甲酰脲类，

[0368] 例如，双三氟虫脲 (bistrifluron)、氟啶脲 (chlofluazuron)、除虫脲 (diflubenzuron)、啶蜱脲 (fluazuron)、氟环脲 (flucycloxuron)、氟虫脲 (flufenoxuron)、氟铃脲 (hexaflumuron)、虱螨脲 (lufenuron)、氟酰脲 (novaluron)、多氟脲 (noviflumuron)、氟幼脲 (penfluron)、氟苯脲 (teflubenzuron)、杀铃脲 (triflumuron)

[0369] 噻嗪酮 (buprofezin)

[0370] 灭蝇胺 (cyromazine)

[0371] 氧化磷酸化抑制剂类，ATP 干扰剂类

[0372] 丁醚脲 (diafenthiuron)

[0373] 有机锡化合物类，

[0374] 例如三唑锡 (azocyclotin)、三环锡 (cyhexatin)、苯丁锡 (fenbutatin oxide)

[0375] 通过间断 H- 质子梯度而起作用的氧化磷酸化去偶剂类

[0376] 吡咯类，

[0377] 例如虫螨腈 (chlorfenapyr)

[0378] 二硝基酚类，

[0379] 例如乐杀螨 (binapacyrl)、消螨通 (dinobuton)、敌螨普 (dinocap)、二硝甲酚 (DNOC)、

[0380] 位点 -I 电子转移抑制剂类

[0381] METI 类，

[0382] 例如喹螨醚 (fenazaquin)、唑螨酯 (fenpyroximate)、嘧螨醚 (pyrimidifen)、哒螨灵 (pyridaben)、吡螨胺 (tebufenpyrad)、唑虫酰胺 (tolfenpyrad)

[0383] 伏蚁腙 (hydramethylnon)

[0384] 三氯杀螨醇 (dicofol)

[0385] 位点 -II 电子转移抑制剂类

[0386] 鱼藤酮 (rotenone)

[0387] 位点 -III 电子转移抑制剂类

[0388] 灭螨醌 (acequinocyl)、嘧螨酯 (fluacrypyrim)

[0389] 昆虫肠道膜微生物干扰剂类

[0390] 苏云金杆菌 (Bacillus thuringiensis) 菌株

[0391] 脂质合成抑制剂类

[0392] 特窗酸类，

[0393] 例如，螺螨酯 (spirodiclofen)、螺甲螨酯 (spiromesifen)

[0394] 特特拉姆酸类 (tetramic acid)，

[0395] 例如，spirotetramat

[0396] 甲酰胺类，

[0397] 例如氟啶虫酰胺 (flonicamid)

[0398] 章鱼胺能激动剂类，

[0399] 例如虫螨脒 (amitraz)

[0400] 镁刺激的 ATP 酶抑制剂类，

[0401] 炔螨特 (propargite)

[0402] 沙蚕毒素类似物，

[0403] 例如硫赐安 (thiocyclam hydrogen oxalate)、杀虫双 (thiosultap-sodium)

[0404] 杀罗定 (ryanodin) 受体激动剂类

[0405] 苯甲酸二甲酰胺类，

[0406] 例如 flubendiamid

[0407] 邻氨基苯甲酰胺类，

[0408] 例如 pynaxypyr(3- 溴 -N-{4- 氯 -2- 甲基 -6-[(甲氨基) 羰基] 苯基 }-1-(3- 氯吡啶 -2- 基)-1H- 吡唑 -5- 甲酰胺)

[0409] 生物制剂类、激素类或信息素类

[0410] 艾扎丁 (azadirachtin)、杆菌属种 (Bacillus spec.)、僵菌属种 (Beauveria spec.)、十二碳二烯醇 (codlemone)、绿僵菌属种 (Metarrhizium spec.)、拟青霉属种 (Paecilomyces spec.)、敌贝特 (thuringiensin)、轮枝菌属种 (Verticillium spec.)

[0411] 具有未知或未确定作用机理的活性化合物类

[0412] 熏蒸剂类，

[0413] 例如，磷化铝、一溴甲烷、磺酰氟

[0414] 拒食剂类，

[0415] 例如，冰晶石、氟啶虫酰胺 (flonicamid)、吡蚜酮 (pymetrozine)

[0416] 螨生长抑制剂类，

[0417] 例如，四螨嗪 (clofentezine)、乙螨唑 (etoxazole)、噻螨酮 (hexythiazox)

[0418] amidoflumet、benclothiaz、苯螨特 (benzoximate)、联苯肼酯 (bifenazate)、溴螨酯 (bromopropylate)、噻嗪酮 (buprofezin)、灭螨锰 (chinomethionat)、杀虫脒 (chlordimeform)、乙酯杀螨醇 (chlorobenzilate)、氯化苦 (chloropicrin)、clothiazoben、cycloprene、cyflumetofen、地昔尼尔 (dicyclanil)、fenoxacrim、氟硝二苯胺 (fentrifanil)、噻唑螨 (flubenzimine)、flufenerim、氟螨嗪 (flutenzin)、诱虫十六酯 (gossyplure)、伏蚁腙 (hydramethylnone)、japonilure、恶虫酮 (metoxadiazone)、石油、增效醚 (piperonyl butoxide)、油酸钾、啶虫丙醚 (pyridalyl)、氟虫胺 (sulfluramid)、三氯杀螨砜 (tetradifon)、杀螨硫醚 (tetrasul)、苯螨噻 (triarathene)、增效炔醚

(verbutin)

[0419] 还可与其他已知活性化合物例如除草剂、肥料、生长调节剂、安全剂、信息化学素相混合，或者与改善植物特性的试剂相混合。

[0420] 本发明的活性化合物用作杀虫剂时，还可以其市售制剂和由所述制剂制备的使用形式、作为与增效剂的混合物存在。增效剂为提高活性化合物的活性、而所添加的增效剂本身不必具有活性的化合物。

[0421] 本发明的活性化合物用作杀虫剂时，还可以其市售制剂和由所述制剂制备的使用形式、作为与这样一种抑制剂的混合物存在，所述抑制剂可减少活性化合物在用于植物的环境中、植物部位表面或植物组织中后的降解。

[0422] 由市售制剂制备的使用形式的活性化合物含量可在较宽的范围内变化。使用形式的活性化合物浓度可为 0.00000001-95 重量％的活性化合物，优选 0.00001 和 1 重量％之间。

[0423] 所述化合物以适合于使用形式的常规方式施用。

[0424] 所有植物及植物部位均可依据本发明处理。本发明中植物的含义应理解为所有的植物及植物种群，例如需要的及不需要的野生植物或作物植物（包括天然存在的作物植物）。作物植物可为可通过常规植物育种和优选法或通过生物技术和遗传工程方法或通过前述方法的结合而获得的植物，包括转基因植物和包括受植物种苗权保护或不受其保护的植物栽培种。植物部位的含义应理解为植物所有的地上及地下部位及器官，例如芽、叶、花和根，可提及的实例有叶、针叶、茎、干、花、子实体、果实、种子、根、块茎和根茎。植物部位还包括采收物，及无性与有性繁殖物，例如插枝、块茎、根茎、分枝和种子。

[0425] 根据本发明用活性化合物对植物及植物部位的处理，通过常规处理方法直接进行或使化合物作用于其环境、生境或贮存空间而进行，所述常规处理方法例如浸渍、喷雾、蒸发、弥雾、撒播、涂抹、注射，并且，对于繁殖物，特别是对于种子，还可施用一层或多层包衣。

[0426] 根据本发明用活性化合物结合物对植物及植物部位的处理，通过常规处理方法直接进行或使混合物作用于其环境、生境或贮存空间而进行，所述常规处理方法例如浸渍、喷雾、蒸发、弥雾、撒播、涂抹、注射，并且，对于繁殖物，特别是对于种子，还可施用一层或多层包衣。

[0427] 本发明的混合物特别适于处理种子。此处，以上作为优选或特别优选提及的本发明结合物可作为优选提及。如此，大部分由害虫引起的对作物植物的破坏早在种子贮存期间受侵染之时和种子播种入土壤之后的植物发芽期间和刚发芽之后而发生。这个阶段特别重要，因为生长中的植物的根和芽特别敏感，即使微小损害也可导致整株植物的死亡。因此通过使用适宜组合物保护种子和发芽中的植物具有特别重大的意义。

[0428] 通过处理植物种子来防治害虫为长期已知并且是不断改进的主题。但是，种子的处理经常伴有一系列问题，这些问题不能总是以令人满意的方式解决。因此，需要开发用于保护种子和发芽中的植物的方法，该方法无需在播种之后或植物出苗之后另外施用作物保护剂。而且希望优化活性化合物的施用量以对种子和发芽植物提供最佳保护免受害虫侵染，而施用的活性化合物不损害植物本身。特别是，处理种子的方法还应该考虑到转基因植物的固有杀虫特性，以便施用最小量的作物保护剂而达到对种子和发芽植物的最佳保护。

[0429] 因此本发明还特别涉及通过用本发明组合物处理种子来保护种子和发芽植物免

受害虫侵染的方法。本发明同样涉及本发明组合物用于处理种子以保护种子和生成的植株免于害虫侵害的用途。此外，本发明涉及已用本发明组合物处理以提供保护使其免于害虫侵害的种子。

[0430] 本发明的一个优点为本发明组合物的特殊的内吸特性，这意味着用这些组合物处理种子，不仅保护种子本身而且保护出苗后的植物免受害虫侵袭。用此方法，可以省却在播种时或其后不久立即对作物进行处理。

[0431] 另一个优点为，与单个杀虫活性化合物相比，本发明组合物具有协同增加的杀虫活性，该活性超过两种活性化合物单独施用时的预期活性。还有的优点为与单个杀真菌的活性化合物相比，本发明组合物具有协同增加的杀真菌活性，该活性超过活性化合物单独施用时的预期活性。这使得可优化活性化合物的施用量。

[0432] 此外，应当认为有利的是，本发明混合物也可特别用于转基因种子，从该种子萌芽的植物能够表达对抗害虫的蛋白。通过用本发明组合物处理这类种子，某些害虫可仅通过例如杀虫蛋白的表达进行防治，另外本发明组合物还保护种子免受损害。

[0433] 本发明组合物适于保护上面已提及的在农业、温室、森林或园艺中使用的任何植物品种的种子。特别是以下形式的植物种子：玉米、花生、油菜、油籽油菜、罂粟、大豆、棉花、甜菜（例如糖用甜菜和饲用甜菜）、稻、蜀黍和粟、小麦、大麦、燕麦、黑麦、向日葵、烟草、马铃薯或蔬菜（例如西红柿、卷心菜植物）。本发明组合物同样适于处理上面已提及的水果植物和蔬菜的种子。对玉米、大豆、棉花、小麦和油菜或油籽油菜的种子的处理特别重要。

[0434] 如上已提及，用本发明组合物处理转基因种子也特别重要。其为这样的植物种子形式，即通常含有至少一种异源基因，该异源基因支配特别是具有杀虫特性的多肽的表达。本文中，转基因种子中的异源基因可源于微生物例如芽孢杆菌 (Bacillus)、根瘤菌 (Rhizobium)、假单胞菌 (Pseudomonas)、沙雷氏菌 (Serratia)、木霉 (Trichoderma)、Clavibacter、血管球 (Glomus) 或者黏帚霉 (Gliocladium)。本发明特别适于处理含有至少一种源于芽孢杆菌属并且其基因产物显示出抗欧洲玉米螟 (European corn borer) 和 / 或玉米根虫 (corn rootworm) 活性的异源基因的转基因种子。特别优选源于苏云金杆菌的异源基因。

[0435] 在本发明范围内，本发明组合物单独地或以合适剂型施用于种子。优选在种子稳定得足以避免处理期间的损害的状态下处理种子。通常种子可在采收和播种之间的任意时间点进行处理。通常使用的种子已从植物中分离并已除去穗轴、壳、茎、表皮、毛或果肉。

[0436] 处理种子时，通常必须注意的是，本发明组合物施用于种子的量和 / 或其他添加剂的量应选择为不会不利地影响种子的发芽或者不会损害生成的植株。特别是对于在某些施用率时具有植物毒性效应的活性化合物而言，这一点必须牢记。

[0437] 如上所提及，可依据本发明处理所有植物及其部位。在一个优选实施方案中，对野生植物种和植物栽培种，或由常规生物育种方法例如杂交或原生质体融合而获得的植物种和植物栽培种，及它们的部位进行处理。在另一个优选实施方案中，对由遗传工程方法——如果合适，与常规方法相结合——而获得的转基因植物和植物栽培种（遗传修饰生物）及其部位进行处理。术语“部位”、“植物的部位”和“植物部位”解释如上。

[0438] 特别优选地，对各自市售或已使用的植物栽培种的植物按本发明处理。植物栽培种的含义理解为由常规育种、诱变或重组 DNA 技术而获得的具有新特性（“特征”）的植物。

它们可以是栽培种、生物型或基因型。

[0439] 依据植物种或植物栽培种、其种植地点和生长条件（土壤、气候、生长期、营养(diet)），本发明的处理也可产生超加和（“协同”）效应。由此可取得如下超过实际预期的效果，例如降低可依据本发明使用的物质和组合物的施用率和／或加宽其作用谱和／或提高其活性、改善植物生长、提高高温或低温耐受性、提高对干旱或水或土壤含盐量的耐受性、提高开花品质、使采收更简易、加速成熟、提高采收产率、提高采收产品的质量和／或提高其营养价值、改善采收产品的贮存稳定性和／或其加工性能。

[0440] 优选依据本发明处理的（通过遗传工程而获得的）转基因植物或植物栽培种包括通过基因修饰而接受了遗传物质的所有植物，所述遗传物质赋予了所述植物特别有利的有用特征。所述特征的实例有改善植物生长状况、提高高温或低温耐受性、提高对干旱或水或土壤含盐量的耐受性、提高开花品质、使采收更简易、加速成熟、提高采收产率、提高采收产品的质量和／或提高其营养价值、改善采收产品的贮存稳定性和／或其加工性能。所述特征的特别强调的其他实例有改善植物对动物害虫和微生物有害物的抵抗力，例如对昆虫、螨虫、植物致病真菌、细菌和／或病毒的抵抗力，以及提高植物对某些除草活性化合物的耐受性。可提及的转基因植物的实例为重要的作物植物，例如谷物（小麦、稻）、玉米、大豆、马铃薯、甜菜、西红柿、豌豆及其他蔬菜品种、棉花、烟草、油籽油菜以及果实植物（果实为苹果、梨、柑橘类水果及葡萄），特别强调玉米、大豆、马铃薯、棉花、烟草和油籽油菜。所强调的特征尤其为通过在植物体内形成的毒素，特别是由苏云金杆菌的遗传物质（例如基因Cry I A(a)、Cry I A(b)、Cry I A(c)、Cry II A、Cry III A、Cry III B2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb 和 Cry I F 及其结合）在植物体内形成的毒素，来提高植物对昆虫、蛛形纲动物、线虫和蛞蝓以及蜗牛的抵抗力（以下简称为“Bt 植物”）。还特别强调的特征为通过系统获得性抗性 (SAR)、系统素、植物抗毒素、引发物 (elicitor) 和抗性基因以及相应的表达蛋白质和毒素来提高植物对真菌、细菌和病毒的抵抗力。此外特别强调的特征为提高植物对某些除草活性化合物的耐受性，例如对咪唑啉酮类、磺酰脲类、草甘磷 (glyphosate) 或草丁膦 (phosphinotricin) 的耐受性（例如“PAT”基因）。赋予所述所需特征的基因也可在转基因植物体内相互结合而存在。可提及的“Bt 植物”的实例有市售的商品名称为YIELD **GARD®**（例如玉米、棉花、大豆）、**KnockOut®**（例如玉米）、**StarLink®**（例如玉米）、**Bollgard®**（棉花）、**Nucoton®**（棉花）和**NewLeaf®**（马铃薯）的玉米品种、棉花品种、大豆品种和马铃薯品种。可提及的除草剂耐受性植物的实例有市售的商品名称为Roundup **Ready®**（具有草甘磷耐受性，例如玉米、棉花、大豆）、Liberty **Link®**（具有草丁膦耐受性，例如油籽油菜）、**IMI®**（具有咪唑啉酮耐受性）和**STS®**（具有磺酰脲耐受性，例如玉米）的玉米品种、棉花品种和大豆品种。可提及的具有除草剂抗性的植物（以常规方式育种的除草剂耐受性植物）包括名称为**Clearfield®**（例如玉米）的市售品种。当然，以上叙述也适用于具有所述基因特征或待开发基因特征的植物栽培种，所述植物栽培种将在未来进行开发和／或上市。

[0441] 所列植物可用本发明的通式 I 化合物和／或活性化合物混合物以特别有利的方式依据本发明进行处理。上述活性化合物或混合物的优选范围也适用于所述植物的处理。特别强调用本说明书中具体提及的化合物或混合物处理植物。

[0442] 本发明活性化合物不仅对植物害虫、卫生害虫和贮存产品害虫起作用，而且也可

对兽医领域中的动物寄生虫（体外寄生虫和体内寄生虫）例如硬蜱、软蜱、兽疥螨、叶螨、蝇（叮咬和吸食）、寄生蝇幼虫、虱、毛虱、羽虱和蚤起作用。所述寄生虫包括：

[0443] 虱目(Anoplurida)，例如，血虱属(Haematopinusspp.)、毛虱属(Linognathus spp.)、虱属(Pediculus spp.)、Phtirus spp.、管虱属(Solenopotes spp.)。

[0444] 食毛目(Mallophagida)及钝角亚目(Amblycerina)和细角亚目(Ischnocerina)，例如，毛羽虱属(Trimenopon spp.)、禽虱属(Menopon spp.)、巨羽虱属(Trinoton spp.)、牛羽虱属(Bovicolaspp.)、Werneckiella spp.、Lepikentron spp.、畜虱属(Damalinaspp.)、嚼虱属(Trichodectes spp.)、猫羽虱属(Felicola spp.)。双翅目及长角亚目(Nematocerina)和短角亚目(Brachycerina)，例如，伊蚊属(Aedes spp.)、按蚊属(Anopheles spp.)、库蚊属(Culex spp.)、蚋属(Simulium spp.)、真蚋属(Eusimulium spp.)、白蛉属(Phlebotomus spp.)、罗蛉属(Lutzomyia spp.)、库蠓属(Culicoides spp.)、斑虻属(Chrysops spp.)、瘤虻属(Hybomitraspp.)、黄虻属(Atylotus spp.)、虻属(Tabanus spp.)、麻虻属(Haematopota spp.)、Philipomyia spp.、蜂虱蝇属(Braula spp.)、家蝇属(Musca spp.)、齿股蝇属(Hydrotaea spp.)、螫蝇属(Stomoxysspp.)、黑角蝇属(Haematobia spp.)、莫蝇属(Morellia spp.)、厕蝇属(Fannia spp.)、舌蝇属(Glossina spp.)、丽蝇属(Calliphoraspp.)、绿蝇属(Lucilia spp.)、金蝇属(Chrysomyia spp.)、污蝇属(Wohlfahrtia spp.)、麻蝇属(Sarcophaga spp.)、狂蝇属(Oestrusspp.)、皮蝇属(Hypoderma spp.)、胃蝇属(Gasterophilus spp.)、虱蝇属(Hippobosca spp.)、羊虱蝇属(Lipoptena spp.)、蜱蝇属(Melophagus spp.)。

[0445] 蚤目(Siphonapterida)，例如，蚤属(Pulex spp.)、栉首蚤属(Ctenocephalides spp.)、客蚤属(Xenopsylla spp.)、角叶蚤属(Ceratophyllus spp.)。

[0446] 异翅目(Heteropterida)，例如，臭虫属(Cimex spp.)、锥猎蝽属(Triatoma spp.)、红猎蝽属(Rhodnius spp.)、锥蝽属(Panstrongylus spp.)。

[0447] 蜚蠊目(Blattarida)，例如，东方蜚蠊(Blattaorientalis)、美洲大蠊(Periplanet aamericana)、德国蠊(Blattela germanica)、夏柏拉蟑螂属(Supella spp.)。

[0448] 蜱螨(Acari或Acarina)亚纲及后气门目(Metastigmate)和中气门目(Mesostigmata)，例如，锐缘蜱属(Argas spp.)、钝缘蜱属(Ornithodorus spp.)、残喙蜱属(Otobius spp.)、硬蜱属(Ixodesspp.)、花蜱属(Amblyommaspp.)、牛蜱属(Boophilus spp.)、革蜱属(Dermacentor spp.)、Haemophysalis spp.、璃眼蜱属(Hyalommaspp.)、扇头蜱属(Rhipicephalus spp.)、皮刺螨属(Dermanyssusspp.)、刺利螨属(Raillietia spp.)、肺刺螨属(Pneumonyssus spp.)、胸刺螨属(Sternostoma spp.)、蜂螨属(Varroa spp.)。

[0449] 轴螨目(Actinedida)(前气门亚目(Prostigmata))和粉螨目(Acaridida)(无气门亚目(Astigmata))，例如，蜂盾螨属(Acarapisspp.)、姬螯螨属(Cheyletiella spp.)、禽螯螨属(Ornithocheyletiaspp.)、肉螨属(Myobia spp.)、疮螨属(Psorergates spp.)、蠕形螨属(Demodex spp.)、恙螨属(Trombicula spp.)、Listrophorusspp.、粉螨属(Acarus spp.)、食酪螨属(Tyrophagus spp.)、嗜木螨属(Caloglyphus spp.)、颈下螨属(Hypodectes spp.)、翅螨属(Pterolichus spp.)、痒螨属(Psoroptes spp.)、皮螨属(Chorioptesspp.)、耳疥螨属(Otodectes spp.)、疥螨属(Sarcoptes spp.)、耳螨属

(Notoedres spp.)、疥螨属(Knemidocoptes spp.)、气囊螨属(Cytodites spp.)、鸡雏螨属(Laminosioptes spp.)。

[0450] 本发明式(I)活性化合物也适于防治侵染以下动物的节肢动物:农业生产型家畜,例如牛、绵羊、山羊、马、猪、驴、骆驼、水牛、兔、家鸡、火鸡、鸭、鹅、蜜蜂;其他宠物类,例如狗、猫、笼鸟及观赏鱼;以及所谓的试验动物,例如仓鼠、豚鼠、大鼠和小鼠。通过防治这些节肢动物,将会减少死亡和(肉、奶、毛、皮、蛋、蜜等)产量降低的情况,从而可通过使用本发明活性化合物使畜牧更经济和更简便。

[0451] 本发明活性化合物以已知方式通过以下形式用于兽医领域和畜牧业中:通过例如片剂、胶囊剂、饮剂、兽用顿服药、颗粒剂、膏剂、丸剂、喂服(feed-through)法和栓剂的形式进行肠内给药,通过例如注射(肌内、皮下、静脉内、腹膜内等)、植入进行肠胃外给药,通过鼻部给药,通过例如浸渍或沐浴(bathing)、喷雾、浇注(pouringon)和点滴、清洗和撒粉的方式进行皮肤给药,以及借助于含有活性化合物的模型制品例如颈圈、耳标、尾标、肢体缚带(limb band)、笼头、标识器等。

[0452] 用于家畜、家禽、宠物等动物时,式(I)活性化合物可作为含有1-80重量%量的活性化合物的制剂(例如粉剂、乳剂、自由流动组合物剂)直接使用或稀释100-10000倍后使用,或者它们可作为化学浴剂使用。

[0453] 此外已发现本发明化合物对破坏工业材料的昆虫也具有强杀虫作用。

[0454] 以下昆虫可作为实例和优选而提及——但并非限制性的:

[0455] 甲虫,例如北美家天牛(Hylotrupes bajulus)、Chlorophoruspilosis、家具窃蠹(Anobium punctatum)、报死窃蠹(Xestobiumrufovillosum)、梳角细脉窃蠹(Ptilinus pecticornis)、Dendrobiumpertinex、松窃蠹(Ernobius mollis)、Priobium carpini、褐粉蠹(Lyctus brunneus)、非洲粉蠹(Lyctus africanus)、南方粉蠹(Lyctus planicollis)、栉粉蠹(Lyctus linearis)、柔毛粉蠹(Lyctuspubescens)、Trogoxylon aequale、鳞毛粉蠹(Minthes rugicollis)、材小蠹种(Xyleborus spec.)、Tryptodendron spec.、咖啡黑长蠹(Apate monachus)、槲长蠹(Bostrychus capucins)、褐异翅长蠹(Heterobostrychus brunneus)、棘长蠹种(Sinoxylon spec.)、竹长蠹(Dinoderus minutus);

[0456] 膜翅目昆虫(Hymenopteron),例如大树蜂(Sirex juvencus)、枞大树蜂(Urocerus gigas)、泰加大树蜂(Urocerus gigas taignus)、Urocerus augur;

[0457] 白蚁,例如欧洲木白蚁(Kalotermes flavicollis)、麻头堆砂白蚁(Cryptotermes brevis)、灰点异白蚁(Heterotermes indicola)、欧美散白蚁(Reticulitermes flavipes)、桑特散白蚁(Reticulitermes santonensis)、南欧网纹白蚁(Reticulitermeslucifugus)、达尔文澳白蚁(Mastotermes darwiniensis)、内华达古白蚁(Zootermopsis nevadensis)、家白蚁(Coptotermesformosanus);

[0458] 蠹虫(Bristletail),例如衣鱼(Lepisma saccharina)。

[0459] 这里工业材料的含义应理解为非活体材料,例如,优选塑料、粘合剂、胶料、纸张和纸板、皮革、木材,以及加工木制产品和涂料组合物。

[0460] 即用组合物如果合适可含有其他杀昆虫剂,并且如果合适还可含有一种或多种杀真菌剂。

[0461] 关于其他可能的添加剂,可参考以上提及的杀昆虫剂和杀真菌剂。

[0462] 本发明化合物同样可用于保护与盐水或微咸水接触的物体，例如船体、筛、网、建筑物、码头及信号系统，以防产生污垢。

[0463] 此外，本发明化合物可单独地或与其他活性化合物结合用作防污剂。

[0464] 在家用、卫生和贮存产品保护中，本发明活性化合物还适于防治密闭空间内发现的动物害虫，特别是昆虫、蛛形纲动物和螨虫，所述密闭空间例如住所、工厂车间、办公室、交通工具舱室等。它们可单独地或与其他活性化合物和助剂相结合地用在家用杀虫产品中防治所述害虫。它们对敏感的及抗性物种以及对全部发育阶段均有活性。所述害虫包括：

[0465] 蝎目 (Scorpionidea)，例如地中海黄蝎 (Buthus occitanus)。

[0466] 蜱螨目，例如波斯锐缘蜱 (Argas persicus)、鸽锐缘蜱 (Argasreflexus)、苔螨亚种 (Bryobia ssp.)、鸡皮刺螨、家嗜甜螨 (Glyciphagus domesticus)、非洲钝缘蜱 (Ornithodorus moubat)、血红扇头蜱 (Rhipicephalus sanguineus)、阿氏真恙螨 (Trombiculaalfreddugesi)、Neutrombicula autumnalis、特嗜皮螨 (Dermatophagoides pteronissimus)、法嗜皮螨 (Derma tophagoidesforinae)。

[0467] 蜘蛛目 (Araneae)，例如捕鸟蛛 (Avicul ariidae)、圆蛛 (Araneidae)。

[0468] 盲蛛目 (Opiliones)，例如螯蝎 (Pseudoscorpiones chelifer)、Pseudoscorpiones cheiridium、长跷盲蛛 (Opiliones phalangium)。

[0469] 等足目，例如栉水虱、球鼠妇。

[0470] 倍足目，例如 Blaniulus guttulatus、山蛩虫属 (Polydesmusspp.)。

[0471] 唇足目，例如地蜈蚣属。

[0472] 衣鱼目 (Zygentoma)，例如栉衣鱼属 (Ctenolepisma spp.)、衣鱼、盗火虫 (Lepismodes inquilinus)。

[0473] 蜚蠊目，例如东方蜚蠊、德国蠊、亚洲蠊 (Blattella asahinai)、马德拉蜚蠊、角腹蠊属 (Panchlora spp.)、木蠊属 (Parcoblatta spp.)、澳洲大蠊 (Periplaneta australasiae)、美洲大蠊、大褐大蠊 (Periplaneta brunnea)、烟色大蠊 (Periplaneta fuliginosa)、棕带蜚蠊 (Supella longipalpa)。

[0474] 跳跃目 (Saltatoria)，例如家蟋。

[0475] 革翅目，例如欧洲球蝼。

[0476] 等翅目，例如木白蚁属 (Kalotermes spp.)、散白蚁属。

[0477] 啮虫目 (Psocoptera)，例如 Lepinatus spp.、粉啮虫属 (Liposcelis spp.)。

[0478] 鞘翅目 (Coleoptera)，例如圆皮蠹属、毛皮蠹属、皮蠹属、长头谷盗 (Latheticus oryzae)、隐跗郭公虫属 (Necrobia spp.)、蛛甲属、谷蠹、谷象 (Sitophilus granarius)、米象 (Sitophilusoryzae)、玉米象 (Sitophilus zeamais)、药材甲 (Stegobiumpaniceum)。

[0479] 双翅目，例如埃及伊蚊 (Aedes aegypti)、白纹伊蚊 (Aedesalbopictus)、带喙伊蚊 (Aedes taeniorhynchus)、按蚊属、红头丽蝇、高额麻虻 (Chrysozona pluvialis)、五带淡色库蚊 (Culexquinquefasciatus)、尖音库蚊 (Culex pipiens)、环喙库蚊 (Culextarsalis)、果蝇属 (Drosophila spp.)、夏厕蝇 (Fannia canicularis)、家蝇 (Musca domestica)、白蛉属、肉蝇 (Sarcophaga carnaria)、蚋属、厩螯蝇 (Stomoxys calcitrans)、欧洲大蚊。

[0480] 鳞翅目，例如小蜡螟 (Achroia grisella)、大蜡螟、印度谷螟 (Plodia

interpunctella)、木塞谷蛾 (Tinea cloacella)、袋谷蛾、幕谷蛾。

[0481] 蚤目，例如犬栉首蚤 (Ctenocephalides canis)、猫栉首蚤 (Ctenocephalides felis)、人蚤 (Pulex irritans)、穿皮潜蚤 (Tunga penetrans)、印鼠客蚤。

[0482] 膜翅目，例如广布弓背蚁 (Camponotus herculeanus)、黑臭蚁 (Lasius fuliginosus)、黑蚁 (Lasius niger)、Lasius umbratus、小家蚁、Paravespula spp.、铺道蚁 (Tetramorium caespitum)。

[0483] 虱目 (Anoplura)，例如头虱 (Pediculus humanus capitis)、体虱 (Pediculus humanus corporis)、Pemphigus spp.、Phylloeravastatrix、阴虱 (Phthirus pubis)。

[0484] 异翅目，例如热带臭虫 (Cimex hemipterus)、温带臭虫 (Cimexlectularius)、长红猎蝽 (Rhodinus prolixus)、侵扰锥猎蝽 (Triatomainfestans)。

[0485] 在家用杀虫剂领域中，它们可单独地或与其他适宜的活性化合物结合使用，所述适宜的活性化合物例如磷酸酯类、氨基甲酸酯类、拟除虫菊酯类、新烟碱类、生长调节剂或其他已知杀虫剂类活性化合物。

[0486] 它们可以以下形式使用：气雾剂、无压喷雾产品，例如泵喷雾和雾化器喷雾、自动雾化系统、雾化剂、泡沫剂、凝胶剂；具有由纤维素或聚合物制得的蒸发片的蒸发剂产品，液态蒸发剂、凝胶和膜蒸发剂，推进器驱动的蒸发剂，无动力或无源蒸发系统；捕蛾纸、捕蛾袋和捕蛾胶；作为颗粒剂或粉末剂；用于抛撒饵料中或毒饵站 (baitstation) 中。

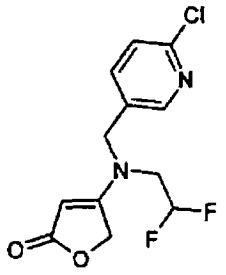
[0487] 制备实施例：

[0488] 方法 1

[0489] 变型方案 A

[0490] 4-[[(6- 氯吡啶 -3- 基) 甲基](2,2- 二氟乙基) 氨基] 呋喃 -2(5H)- 酮

[0491]



[0492] 实例 (1)

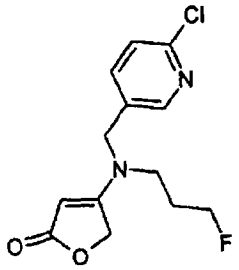
[0493] 在分水器上，将 21.90g(106.0mmol)N-[(6- 氯吡啶 -3- 基) 甲基]-2,2- 二氟乙 -1- 胺 (III-1)、14.85g(148.4mmol) 特窗酸和 183mg(1.1mmol)4- 甲苯磺酸于 250ml 甲苯中加热回流 2 小时。减压浓缩反应混合物，然后将剩余物溶于乙酸乙酯中并将混合物用 1N 盐酸水溶液接连洗涤两次、用 1N 氢氧化钠水溶液洗涤两次并用饱和的氯化钠溶液洗涤一次，将有机相用硫酸钠干燥并在减压下浓缩。通过硅胶 (硅胶 60-Merck，粒度 :0.04-0.063mm) 柱色谱法使用流动相乙酸乙酯纯化剩余物，得到 15.9g(理论值的 52％)4-[[(6- 氯吡啶 -3- 基) 甲基 1(2-2- 二氟乙基) 氨基] 呋喃 -2(5H)- 酮

[0494] ^{1}H-NMR(CD_3CN, δ , ppm) = 3.59(td,2H),4.51(s,2H),4.76(s,1H),4.80(s,2H),6.03(tt,1H),7.38(d,1H),7.64(dd,1H),8.28(d,1H).

[0495] 变型方案 B

[0496] 4-[[(6-氯吡啶-3-基)甲基](3-氟正丙基)氨基]呋喃-2(5H)-酮

[0497]



[0498] 实例(2)

[0499] 先将0.52g(5.18mmol)特窗酸引入1.13ml乙酸中,并在室温下缓慢添加1.00g(4.93mmol)N-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-3-氟丙-1-胺(III-2)。然后将全部反应混合物再在室温下搅拌约18小时。减压浓缩反应混合物,然后将剩余物溶于二氯甲烷中并将混合物用水洗涤。相分离之后,将水相用二氯甲烷萃取两次。然后将合并的有机相用1N氢氧化钠溶液制成碱性(pH>9)并进行相分离。将水相用二氯甲烷萃取两次,并在相分离之后,将合并的有机相用硫酸钠干燥。减压浓缩有机相并通过硅胶(硅胶60-Merck,粒度:0.04-0.063mm)柱色谱法使用流动相混合物乙酸乙酯:环己烷(9:1)纯化剩余物,得到191mg(理论值的14%)4-[[(6-氯吡啶-3-基)甲基](3-氟正丙基)氨基]呋喃-2(5H)-酮。

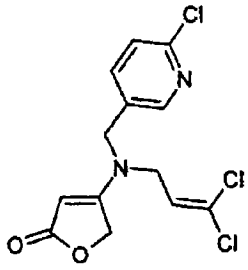
[0500] ^{1}H-NMR(CD_3CN, δ, ppm) = 1.95(m,2H),3.30(t,2H),4.40(s,2H),4.45(dt,2H),4.65(s,1H),4.80(s,2H),7.40(d,1H),7.65(dd,1H),8.28(d,1H).

[0501] 化合物(16)和(17)也以与该方法相似的方法制得。

[0502] 方法2

[0503] 4-[[(6-氯吡啶-3-基)甲基](3,3-二氯丙-2-烯-1-基)氨基]呋喃-2(5H)-酮

[0504]



[0505] 实例(3)

[0506] 将350mg(1.56mmol)4-[[(6-氯吡啶-3-基)甲基]氨基]呋喃-2(5H)-酮(Ia-1;参见EP 0539588 A1)和124mg(3.12mmol)60%的氢化钠的矿物油分散液于100ml四氢呋喃中加热回流3小时。冷却至室温后,添加592mg(3.12mmol)3-溴-1,1-二氯丙-1-烯(参见WO 8800183A1)并将混合物再加热回流5小时。将反应混合物冷却至室温并添加甲醇后,减压浓缩混合物。将剩余物溶于乙酸乙酯中并将混合物用1N盐酸水溶液接连洗涤两次、用1N氢氧化钠水溶液洗涤两次和用饱和的氯化钠溶液洗涤一次。然后将有机相用硫酸钠干燥并进行减压浓缩。通过硅胶(硅胶60-Merck,粒度:0.04-0.063mm)柱色谱法使用流动相混合物乙酸乙酯:环己烷(2:1)纯化剩余物,得到264mg(理论值的50%)4-[[(6-氯吡啶-3-基)甲基](3,3-二氯丙-2-烯-1-基)氨基]呋喃-2(5H)-酮。

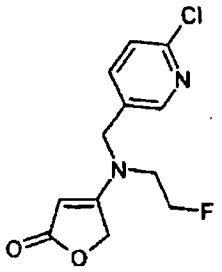
[0507] ^{1}H-NMR(CD_3CN, δ, ppm) = 3.90(d,2H),4.38(s,2H),4.71(s,1H),4.80(s,2H),6.02(t,1H),7.38(d,1H),7.66(dd,1H),8.29(d,1H).

[0508] 类似地,可制备化合物 (9) 和 (12)。

[0509] 方法 3

[0510] 4-[[(6- 氯吡啶 -3- 基) 甲基](2- 氟乙基) 氨基] 呋喃 -2(5H)- 酮

[0511]



[0512] 实例 (4)

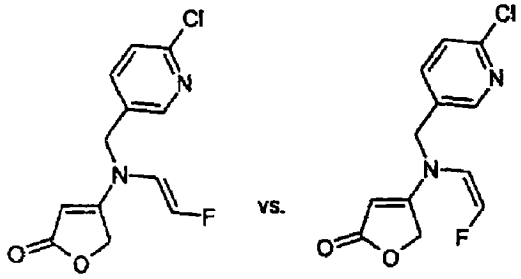
[0513] 将 1.00g(6.89mmol)4-[(2- 氟 乙 基) 氨 基] 呋 喃 -2(5H)- 酮 (VI-1) 和 0.55g(13.78mmol)60％的氢化钠的矿物油分散液于 200ml 四氢呋喃中加热回流 2 小时。冷却至室温后,添加 2.23g(13.78mmol)2- 氯 -5- 氯甲基吡啶,并将混合物再加热回流 4 小时。将反应混合物冷却至室温并添加甲醇。减压浓缩反应混合物之后,将剩余物溶于乙酸乙酯中并将混合物用 1N 盐酸水溶液接连洗涤两次、用 1N 氢氧化钠水溶液洗涤两次和用饱和的氯化钠溶液洗涤一次。然后将有机相用硫酸钠干燥并进行减压浓缩。通过硅胶 (硅胶 60-Merck,粒度 :0.04-0.063mm) 柱色谱法使用流动相混合物乙酸乙酯 : 环己烷 (9:1) 纯化剩余物,得到 949mg(理论值的 50％)4-[[(6- 氯吡啶 -3- 基) 甲基](2- 氟乙基) 氨基] 呋喃 -2(5H)- 酮。

[0514] ^{1}H-NMR(CD_3CN, δ, ppm) = 3.50(dt,2H),4.50(s,2H),4.57(dt,2H),4.65(s,1H),4.79(s,2H),7.38(d,1H),7.65(dd,1H),8.28(d,1H).

[0515] 类似地,可制备化合物 (10)、(11)、(13)、(14) 和 (15)。

[0516] (E/Z)-4-[[(6- 氯 吡 啶 -3- 基) 甲 基](2- 氟 乙 烯 基) 氨 基]-5- 甲 基 呋喃 -2(5H)- 酮

[0517]



(E)- 异构体 (Z)- 异构体

[0518] 实例 (5)

[0519] 先将 68mg(0.22mmol)4-[[(6- 氯吡啶 -3- 基) 甲基](2- 氯 -2- 氟乙基) 氨基] 呋喃 -2(5H)- 酮 (17) 引入 5ml 乙醇中,添加 38mg(0.67mmol) 氢氧化钾并将反应混合物在室温搅拌约 18 小时。然后反应混合物在乙酸乙酯和水之间进行分配,分离出有机相。将有机相用饱和的氯化钠溶液洗涤,用硫酸钠干燥并进行减压浓缩。通过硅胶 (硅胶 60-Merck,

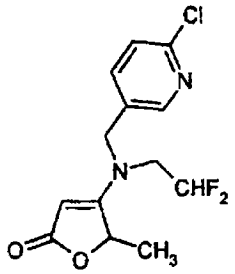
粒度 :0.04-0.063mm) 柱色谱法使用流动相混合物乙酸乙酯 : 环己烷 (2:1) 纯化剩余物,得到 57mg(理论值的 94%)4-[[(6- 氯吡啶 -3- 基) 甲基](2- 氟乙烯基) 氨基]-5- 甲基呋喃 -2(5H)- 酮的 (E/Z) 异构体混合物 (15:85)。

[0520] ^{1}H-NMR(CD_3CN, δ , ppm) = 4.75(s,2H),4.84(s,2H),4.88(s,1H),5.60(dd,1H),6.37(dd,1H),7.39(d,1H),7,67(dd,1H),8.29(d,1H)[(Z) 异构体 ;根据 NMR 为 85%]。

[0521] ^{1}H-NMR(CD_3CN, δ , ppm) = 6.90(dd,1H)[(E) 异构体 ;根据 NMR 为 15%]。

[0522] 4-[[(6- 氯吡啶 -3- 基) 甲基](2,2- 二氟乙基) 氨基]-5- 甲基呋喃 -2(5H)- 酮

[0523]



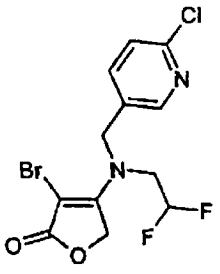
[0524] 实例 (6)

[0525] 将 300mg(1.04mmol)4-[[(6- 氯吡啶 -3- 基) 甲基](2,2- 二氟乙基) 氨基] 呋喃 -2(5H)- 酮溶于 10ml 四氢呋喃,将溶液冷却至 -78℃并加入 611μl(1.04mmol)1.7M 的叔丁基锂的戊烷溶液。在 -78℃搅拌 30min 后,加入 65μl(1.04mmol) 碘代甲烷,在 -78℃再继续搅拌 30min 并将混合物温热至室温。减压浓缩反应混合物,并通过硅胶 (硅胶 60-Merck, 粒度 :0.04-0.063mm) 柱色谱法使用流动相混合物乙酸乙酯 : 环己烷 (2:1) 纯化剩余物,得到 152mg(理论值的 47%)4-[[(6- 氯吡啶 -3- 基) 甲基](2,2- 二氟乙基) 氨基]-5- 甲基呋喃 -2(5H)- 酮。

[0526] ^{1}H-NMR(CD_3CN, δ ppm) = 1.48(d,3H),3.59(m,2H),4.48(d,1H),4.58(d,1H),4.73(s,1H),5.10(q,1H),6.06(tt,1H),7.40(d,1H),7.65(dd,1H),8.28(d,1H).

[0527] 3- 溴 -4-[[(6- 氯吡啶 -3- 基) 甲基](2,2- 二氟乙基) 氨基] 呋喃 -2(5H)- 酮

[0528]



[0529] 实例 (7)

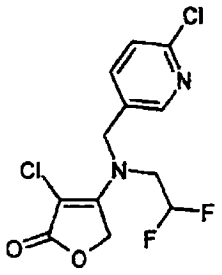
[0530] 将 313mg(1.08mmol)4-[[(6- 氯吡啶 -3- 基) 甲基](2,2- 二氟乙基) 氨基] 呋喃 -2(5H)- 酮 (1) 溶于 20ml 乙腈中,并在室温下加入 166μl(1.19mmol) 三乙胺和 386mg(2.17mmol)N- 溴代琥珀酰亚胺。搅拌 3 小时后,减压浓缩反应混合物。通过硅胶 (硅胶 60-Merck, 粒度 :0.04-0.063mm) 柱色谱法使用流动相混合物乙酸乙酯 : 环己烷 (2:1) 纯化剩余物,得到 312mg(理论值的 63%)3- 溴 -4-[[(6- 氯吡啶 -3- 基) 甲基](2,2- 二氟乙基) 氨基] 呋喃 -2(5H)- 酮。

[0531] ^{1}H-NMR(CD_3CN, δ , ppm) = 3.80(td,2H),4.83(s,2H),4.85(s,2H),6.08(tt,1H),

7.40(d,1H),7.66(dd,1H),8.30(d,1H).

[0532] 3-氯-4-[[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)氨基]呋喃-2(5H)-酮

[0533]



[0534] 实例(8)

[0535] 使用以下物质以与实施例6相似的反应过程进行卤化反应:

[0536] 329mg(1.14mmol)4-[[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)氨基]呋喃-2(5H)-酮(1)

[0537] 0.17ml(1.25mmol)三乙胺

[0538] 304mg(2.28mmol)N-氯代琥珀酰亚胺

[0539] 20ml乙腈

[0540] 残留的剩余物通过硅胶(硅胶60-Merck,粒度:0.04-0.063mm)柱色谱法使用流动相混合物乙酸乙酯:环己烷(2:1)进行纯化,得到292mg(理论值的63%)3-氯-4-[[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)氨基]呋喃-2(5H)-酮。

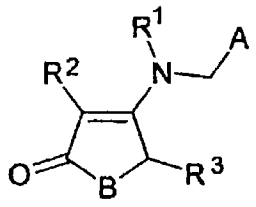
[0541] ^{1}H-NMR(CD_3CN, δ ppm) = 3.79(td,2H),4.78(s,2H),4.82(s,2H),6.07(tt,1H),7.40(d,1H),7.67(dd,1H),8.30(d,1H).

[0542] 式(I)的其他化合物(9)至(17)列于下表1中。

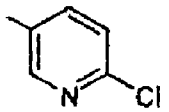
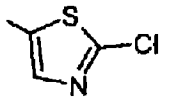
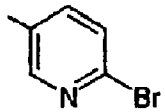
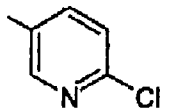
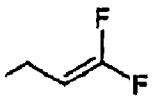
[0543]

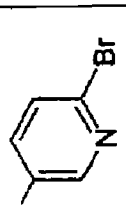
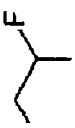
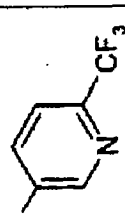
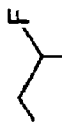
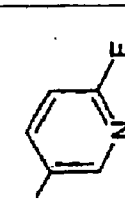
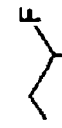
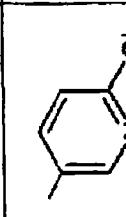
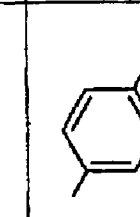
[0544] 表 1

下式的化合物



(I)

实例编号	A	B	R^1	R^2	R^3	物理数据：^{1}H-NMR, δ [ppm]
9		O		H	H	CD_3Cl, δ = 4.62 (s, 2H), 4.93 (s, 2H), 5.00 (s, 1H), 6.50 (t, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.57 (dd, 1H), 8.35 (d, 1H)
10		O		H	H	CD_3CN, δ = 3.48 (dt, 2H), 4.57 (dt, 2H), 4.58 (s, 2H), 4.71 (s, 1H), 4.78 (s, 2H), 7.50 (s, 1H)
11		O		H	H	CD_3CN, δ = 3.50 (dt, 2H), 4.47 (s, 2H), 4.55 (dt, 2H), 4.65 (s, 1H), 4.80 (s, 2H), 7.53 (s, 2H), 8.28 (s, 1H)
12		O		H	H	CD_3CN, δ = 3.78 (dm, 2H), 4.39 (s, 2H), 4.50 (dtd, 1H), 4.68 (s, 1H), 4.80 (s, 2H), 7.38 (d, 1H), 7.65 (dd, 1H), 8.28 (d, 1H)

实例编号	A	B	R^1	R^2	R^3	物理数据：^{1}H-NMR, δ [ppm]
13		O		H	H	CD_3CN, δ = 3.58 (td, 2H), 4.50 (s, 2H), 4.75 (s, 1H), 4.80 (s, 2H), 6.05 (tt, 1H), 7.55 (s, 2H), 8.28 (s, 1H)
14		O		H	H	CD_3CN, δ = 3.61 (td, 2H), 4.63 (s, 2H), 4.75 (s, 1H), 4.80 (s, 2H), 6.05 (tt, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.85 (d, 1 H), 8.62 (s, 1H)
15		O		H	H	CD_3CN, δ = 3.58 (td, 2H), 4.52 (s, 2H), 4.76 (s, 1H), 4.81 (s, 2H), 6.03 (tt, 1H), 7.00 (dd, 1H), 7.78 (td, 1H), 8.10 (s, 1H)
16		CH_2		H	H	CD_3CN, δ = 2.30 (m, 2H), 2.74 (m, 2H), 3.71 (td, 2H), 4.61 (s, 2H), 5.01 (s, 1H), 6.05 (tt, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.28 (d, 1H)
17		O		H	H	CD_3CN, δ = 3.75 (m, 2H), 4.55 (s, 2H), 4.75 (s, 1H), 4.82 (s, 2H), 6.43 (ddd, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.65 (dd, 1H), 8.28 (d, 1H)

[0545] 原料的制备

[0546] 式 (Ia) 的化合物

[0547] Ia-1

[0548] 4-[[(6- 氯吡啶 -3- 基) 甲基] 氨基] 呋喃 -2(5H)- 酮 (参见 EP0539588 A1)

[0549] 在分水器上,将 5.00g(35.1mmol)1-(6- 氯吡啶 -3- 基) 甲胺、3.51g(35.1mmol) 特

窗酸和 20mg(0.12mmol)4- 甲苯磺酸于 200ml 甲苯中加热回流 24 小时。浓缩反应混合物，然后将残留的剩余物通过硅胶（硅胶 60-Merck，粒度 :0.04-0.063mm）柱色谱法使用流动相乙酸乙酯进行纯化。得到 4.96g（理论值的 63％）4-[[(6- 氯吡啶 -3- 基）甲基］氨基］呋喃 -2(5H)- 酮，其可用于随后的反应。

[0550] ^{1}H-NMR($CDCl_3$, δ ppm) = 4.35(d,2H),4.70(s,2H),4.80(s,1H),4.95(br.s,1H),7.36(d,1H),7.61(dd,1H),8.37(d,1H).

[0551] 式 (III) 的化合物

[0552] III-1

[0553] N-[(6- 氯吡啶 -3- 基）甲基］-2,2- 二氟乙 -1- 胺

[0554] 将 41.57g(256.6mmol)2- 氯 -5- 氯甲基吡啶、20.80g(256.6mmol)2,2- 二氟乙 -1- 胺和 35.8ml(256.6mmol) 三乙胺于 500ml 乙腈中在 45℃搅拌 21 小时。减压浓缩反应混合物，然后将剩余物溶于 1N 盐酸水溶液中并将混合物用乙酸乙酯洗涤。将水相用 2.5N 氢氧化钠水溶液制成碱性并用乙酸乙酯反复萃取。减压浓缩有机相，得到 28.6g（理论值的 53％）N-[(6- 氯吡啶 -3- 基）甲基］-2,2- 二氟乙 -1- 胺。

[0555] ^{1}H-NMR(CD_3CN, δ , ppm) = 2.93(td,2H),3.80(s,2H),5.85(tt,1H),7.33(d,1H),7.71(dd,1H),8.30(d,1H).

[0556] 可类似地制备以下化合物 :

[0557] III-2

[0558] N-[(6- 氯吡啶 -3- 基）甲基］-3- 氟丙 -1- 胺

[0559] LCMS(m/z, ％) = 203(MH^+,100)。

[0560] III-3

[0561] N-[(6- 氯吡啶 -3- 基）甲基］-2- 氯 -2- 氟乙 -1- 胺

[0562] LCMS(m/z, ％) = 223(MH^+,100)。

[0563] 式 (V) 的化合物

[0564] Va-1

[0565] 2- 氯 - 氟乙 -1- 胺 :

[0566] a) 将 5.00g(44.8mmol)2- 氯 -2- 氟乙酰胺于 50.0ml 四氢呋喃中搅拌，并逐滴加入 51.6ml(103.1mmol) 硼烷 - 甲硫醚络合物。然后将反应混合物在回流温度下搅拌一小时。冷却后，小心地加入 155.7ml(0.45mmol)10％浓度的盐酸，并将混合物在回流温度下再搅拌一小时。然后减压除去四氢呋喃，将剩余物冷却（冰浴）并与乙醚一起搅拌，用氢氧化钠溶液将混合物调至 pH 9。用乙醚将混合物萃取三次，并将 44.8ml(89.7mmol) 氯化氢的二噁烷溶液添加至合并的有机相中从而形成盐酸化物。将沉淀的盐酸化物分离出并再洗涤一次。得到 3.48g（理论值的 58％）2- 氯 -3- 氟乙 -1- 胺盐酸化物。

[0567] b) 为制备游离碱，将 2.03g(50.8mmol) 氢氧化钠粉末添加至 3.40g(25.4mmol)2- 氯 -3- 氟乙 -1- 胺盐酸化物中（将其预先在高真空下进行干燥）。然后可在 100℃蒸馏出该游离碱。得到 2.10g（理论值的 85％）2- 氯 -3- 氟乙 -1- 胺，可将其用于 N-[(6- 氯吡啶 -3- 基）甲基］-2- 氯 -2- 氟乙 -1- 胺 (III-3) 的合成。

[0568] ^{1}H-NMR(CD_3CN, δ ppm) = 3.07(dm,2H),6.17(dt,1H).

[0569] 式 (VI) 的化合物

[0570] VI-1

[0571] 4-[(2- 氟乙基) 氨基] 呋喃 -2(5H)- 酮

[0572] 在分水器上,将 550mg(4.97mmol)2- 氟乙胺盐酸化物、547mg(5.47mmol) 特窗酸、408mg(4.97mmol) 乙酸钠和 9mg(0.05mmol)4- 甲苯磺酸于 50ml 甲苯中加热回流 5 小时。将反应混合物进行减压浓缩,然后溶于乙酸乙酯中并用 1N 氢氧化钠水溶液洗涤。将水相用乙酸乙酯反复萃取并将合并的有机相用硫酸钠干燥。将有机相减压浓缩并将剩余物通过用乙酸乙酯 / 环己烷重结晶进行纯化,得到 300mg(理论值的 42%)4-[(2- 氟乙基) 氨基] 呋喃 -2(5H)- 酮。

[0573] ^{1}H-NMR(CD_3CN, δ , ppm) = 3.40(dq,2H),4.52(dt,2H),4.61(s,1H),4.62(s,2H),5.80(br.s,1H).

[0574] 可以类似方式制备以下化合物 :

[0575] VI-2

[0576] 4-[(2,2- 二氟乙基) 氨基] 呋喃 -2(5H)- 酮

[0577] ^{1}H-NMR(CD_3CN, δ , ppm) = 3.50(tm,2H),4.65(s,2H),4.71(s,1H),5.78(br.s,1H),5.98(tt,1H).

[0578] 生物学实施例

[0579] 实施例 1

[0580] 桃蚜试验 (MYZUPE 喷雾处理)

[0581] 溶剂 : 78 重量份丙酮

[0582] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0583] 乳化剂 :0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0584] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。

[0585] 将被所有阶段的桃蚜 (Myzus persicae) 侵染的白菜 (Brassicapekinensis) 的圆叶片用所需浓度的活性化合物制剂进行喷雾。

[0586] 经所需时间段后,确定以%计的药效。100%意指所有蚜虫被杀死 ;0%意指没有蚜虫被杀死。

[0587] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物显示出良好活性 :见表

[0588]

实例	活性化合物浓度,g/ha	5 天后的杀灭率, %
实例 3	500	100
实例 12	500	100
实例 10	500	100
实例 11	500	100
实例 14	500	100
实例 13	500	100
实例 15	500	100
实例 2	500	100
实例 7	500	100
实例 8	500	100
实例 6	500	100
实例 17	500	100

实例 5	500	100

[0589] 实施例 2

[0590] 桃蚜试验 ;口服 ;(MYZUPE 0)

[0591] 溶剂 : 80 重量份丙酮

[0592] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合,并将浓液用水稀释至所需浓度。

[0593] 在容器中接种所有阶段的桃蚜,通过吮吸所需浓度的活性化合物制剂进行处理。

[0594] 经所需时间段后,确定以%计的药效。100%意指所有蚜虫被杀死 ;0%意指没有蚜虫被杀死。

[0595] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物显示出良好活性 :

[0596] 见表

[0597]

实例	活性化合物浓度,ppm	5 天后的杀灭率, %
实例 2	20	100

[0598] 实施例 3

[0599] 褐飞虱试验 (NILALU 溶液培养处理)

[0600] 溶剂 : 78 重量份丙酮

[0601] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0602] 乳化剂 :0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0603] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。

[0604] 将活性化合物制剂用移液管移至水中。所述浓度指的是每单位体积水中活性化合物的量 (mg/l = ppm)。然后将该水用褐飞虱 (Nilaparvata lugens) 进行侵染。

[0605] 经所需时间段后,确定以%计的药效。100%意指所有飞虱被杀死 ;0%意指没有飞虱被杀死。

[0606] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物显示出良好活性 :见表

[0607]

实例	活性化合物浓度,g/ha	7 天后的杀灭率, %
实例 10	100	100
实例 13	100	100

[0608] 实施例 4

[0609] 辣根猿叶甲试验 (PHAECO 喷雾处理)

[0610] 溶剂 :78 重量份丙酮

[0611] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0612] 乳化剂 :0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0613] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。

[0614] 用所需浓度的活性化合物制剂喷雾白菜的圆叶片,干燥之后,接种辣根猿叶甲 (Phaedon cochleariae) 的幼虫。

[0615] 经所需时间段后,确定以%计的药效。100%意指所有甲虫幼虫被杀死 ;0%意指没

有甲虫幼虫被杀死。

[0616] 在本试验中，例如，以下制备实施例的化合物显示出良好活性：见表

[0617]

实例	活性化合物浓度，g/ha	7 天后的杀灭率，%
实例 11	500	100
实例 13	500	100
实例 15	500	100
实例 17	500	100

[0618] 实施例 5

[0619] 根结线虫试验 (MELGIN 喷雾处理)

[0620] 溶剂：80 重量份丙酮

[0621] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合，并将浓液用水稀释至所需浓度。

[0622] 在容器中装入沙、活性化合物溶液、根结线虫 (Meloidogyneincognita) 卵 / 幼虫的悬浮液和莴苣种子。莴苣种子发芽并且植株发育。在根部，形成瘿瘤。

[0623] 经所需时间段后，通过形成的瘿瘤确定杀线虫活性，以％计。100％意指没有瘿瘤形成；0％意指在经处理的植株上形成的瘿瘤数目与未经处理的对照植株上的瘿瘤数目相当。

[0624] 在本试验中，例如，以下制备实施例的化合物显示出良好活性：见表

[0625]

实例	活性化合物浓度，ppm	14 天后的杀灭率，%
实例 10	20	80
实例 11	20	100

[0626] 实施例 6

[0627] 桃蚜试验，溶液培养处理 (MYZUPE 体系)

[0628] 溶剂： 7 重量份二甲基甲酰胺

[0629] 乳化剂： 2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0630] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合，并将浓液用水稀释至所需浓度。

[0631] 将活性化合物制剂与水混合。所述浓度指的是每单位体积水中活性化合物的量 (mg/l ＝ ppm)。将经处理的水注入盛有豌豆 (Pisumsativum) 植株的容器中，然后将豌豆植株用桃蚜侵染。

[0632] 经所需时间段后，确定以％计的杀灭率。100％意指所有蚜虫被杀死；0％意指没有蚜虫被杀死。

[0633] 在本试验中，例如，以下制备实施例的化合物显示出良好活性：见表

[0634]

实例	活性化合物浓度，ppm	6 天后的杀灭率，%
实例 10	20	100
实例 11	20	100
实例 14	20	100
实例 13	20	100
实例 15	4	100
实例 8	4	98

[0635] 实施例 7

[0636] 棉蚜试验 (APHIGO)

[0637] 溶剂： 7 重量份二甲基甲酰胺

[0638] 乳化剂 :2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0639] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。

[0640] 将被棉蚜 (Aphis gossypii) 重度侵染的陆地棉 (Gossypiumhirsutum) 棉叶通过浸入所需浓度的活性化合物制剂中进行处理。

[0641] 经所需时间段后,确定以％计的杀灭率。100％意指所有蚜虫被杀死 ;0％意指没有蚜虫被杀死。

[0642] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物显示出良好活性 :见表

[0643]

实例	活性化合物浓度,ppm	6 天后的杀灭率， %
实例 10	100	98
实例 11	100	100
实例 14	100	100
实例 13	100	100
实例 15	100	100
实例 8	20	100

[0644] 实施例 8

[0645] 棉蚜试验 ;(APHIGO G)

[0646] 溶剂： 7 重量份二甲基甲酰胺

[0647] 乳化剂： 2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0648] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将浓液用水稀释至所需浓度。

[0649] 将被棉蚜重度侵染的陆地棉植株用所需浓度的活性化合物制剂浇洒。

[0650] 经所需时间段后,确定以％计的杀灭率。100％意指所有蚜虫被杀死 ;0％意指没有蚜虫被杀死。

[0651] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物显示出良好活性 :见表

[0652]

实例	活性化合物浓度,ppm	10 天后的杀灭率， %
实例 10	4	100

[0653] 实施例 9

[0654] 桃蚜 ;(MYZUPE G)

[0655] 溶剂： 7 重量份二甲基甲酰胺

[0656] 乳化剂： 2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0657] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将浓液用水稀释至所需浓度。

[0658] 将被桃蚜重度侵染的甘蓝 (Brassica oleracea) 植株用所需浓度的活性化合物制剂浇洒。

[0659] 经所需时间段后,确定以％计的杀灭率。100％意指所有蚜虫被杀死 ;0％意指没有

蚜虫被杀死。

[0660] 在本试验中，例如，以下制备实施例的化合物显示出良好活性：见表

[0661]

实例	活性化合物浓度，ppm	10 天后的杀灭率，%
实例 10	4	95

[0662] 实施例 10

[0663] 烟粉虱 (BEMITA 喷雾处理)

[0664] 溶剂： 78 重量份丙酮

[0665] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0666] 乳化剂： 0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0667] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合，并将浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。

[0668] 将被烟粉虱 (Bemisia tabaci) 的幼虫侵染的陆地棉的圆叶片用所需浓度的活性化合物制剂进行喷雾。

[0669] 经所需时间段后，确定以％计的药效。100％意指所有烟粉虱被杀死；0％意指没有烟粉虱被杀死。

[0670] 在本试验中，例如，以下制备实施例的化合物显示出良好活性：见表

[0671]

实例	活性化合物浓度，ppm	7 天后的杀灭率，%
实例 13	500	94

[0672] 实施例 11

[0673] 猫栉首蚤；口服 (CTECFE)

[0674] 溶剂： 二甲亚砜

[0675] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合。将部分浓液用柠檬酸化的牛血进行稀释，制得所需浓度。

[0676] 将 20 只未喂食的成体猫栉首蚤 (Ctenocephalides felis) 放入顶部与底部用纱布密封的腔室内。将底部用 parafilm 密封的金属圆筒放在该腔室上。该圆筒含有血 / 活性化合物制剂，该制剂可被猫栉首蚤透过 parafilm 膜而吸收。将血温热至 37℃，而放有猫栉首蚤的腔室处于室温。

[0677] 经所需时间段后，确定以％计的杀灭率。100％意指所有蚤被杀死；0％表示没有蚤被杀死。

[0678] 在本试验中，例如，以下制备实施例的化合物显示出良好活性：见表

[0679]

实例	活性化合物浓度，ppm	2 天后的杀灭率，%
实例 13	100	80
实例 15	100	90

[0680] 实施例 12

[0681] 铜绿蝇试验 (LUCICU)

[0682] 溶剂： 二甲亚砜

[0683] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合，并将浓液用水稀释至所需浓度。

[0684] 将含有经所需浓度的活性化合物制剂处理的马肉的容器接种铜绿蝇 (Lucilia cuprina) 幼虫。

[0685] 经所需时间段后，确定以％计的杀灭率。100％意指所有幼虫被杀死；0％表示没有幼虫被杀死。

[0686] 在本试验中，例如，以下制备实施例的化合物显示出良好活性：见表

[0687]

实例	活性化合物浓度，ppm	2 天后的杀灭率，％
实例 11	100	100
实例 13	100	100
实例 15	100	90
实例 8	100	100

[0688] 实施例 13

[0689] 微小牛蜱试验 (BOOPMI 注射)

[0690] 溶剂：二甲亚砜

[0691] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合，并将浓液用溶剂稀释至所需浓度。

[0692] 将活性化合物溶液注射到微小牛蜱 (Boophilus microplus) 腹中并将动物转移到器皿中并贮存在温度控制室内。

[0693] 经所需时间段后，确定以％计的药效。100％意指没有蜱虫产下任何受精卵。

[0694] 在本试验中，例如，以下制备实施例的化合物显示出良好活性：见表

[0695]

实例	活性化合物浓度， μg/ 动物	7 天后的杀灭率，％
实例 11	20	100

[0696] 生物学比较例

[0697] 实施例 1

[0698] 桃蚜试验 (MYZUPE T)

[0699] 溶剂： 7 重量份二甲基甲酰胺

[0700] 乳化剂： 2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0701] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合，并将浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。

[0702] 将被桃蚜重度侵染的甘蓝叶片通过浸入所需浓度的活性化合物制剂中进行处理。

[0703] 经所需时间段后，确定以％计的杀灭率。100％意指所有蚜虫被杀死；0％意指没有蚜虫被杀死。

[0704] 在本试验中，例如，以下制备实施例的化合物显示出优于现有技术的活性：见表

[0705]

实例	活性化合物浓度，ppm	6 天后的杀灭率，％
实例 85[a)]	20	15
实例 86[a)]	20	50
实例 4	20	80
实例 85[a)]	20	15

实例 1	20	95

[0706] a) 参见 EP 0539588 A1

[0707] 实施例 2

[0708] 桃蚜试验 (MYZUPE 喷雾处理)

[0709] 溶剂： 78 重量份丙酮

[0710] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0711] 乳化剂： 0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0712] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合，并将浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。

[0713] 将被所有阶段的桃蚜侵染的白菜的圆叶片用所需浓度的活性化合物制剂进行喷雾。

[0714] 经所需时间段后，确定以％计的药效。100％意指所有蚜虫被杀死；0％意指没有蚜虫被杀死。

[0715] 在本试验中，例如，以下制备实施例的化合物显示出优于现有技术的活性：见表

[0716]

实例	活性化合物浓度，g/ha	5 天后的杀灭率， %
实例 87a)	100	0
实例 9	100	90
实例 176a)	4	0
实例 16	4	70
实例 89a)	4	0
实例 1	4	80

[0717] a) 参见 EP 0539588 A1

[0718] 实施例 3

[0719] 桃蚜试验，溶液培养处理 (MYZUPE 体系)

[0720] 溶剂： 7 重量份二甲基甲酰胺

[0721] 乳化剂： 2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0722] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合，并将浓液用水稀释至所需浓度。

[0723] 将活性化合物制剂与水混合。所述浓度指的是每单位体积水中活性化合物的量 (mg/l ＝ ppm)。将经处理的水注入含有豌豆植株的容器中，然后将豌豆植株用桃蚜侵染。

[0724] 经所需时间段后，确定以％计的杀灭率。100％意指所有蚜虫被杀死；0％意指没有蚜虫被杀死。

[0725] 在本试验中，例如，以下制备实施例的化合物显示出优于现有技术的活性：见表

[0726]

实例	活性化合物浓度，ppm	6 天后的杀灭率， %
实例 86a)	0.8	75
	0.16	0
实例 4	0.8	100
	0.16	55

实例 85[a)]	0.8	40
实例 1	0.8	100

[0727] [a)] 参见 EP 0539588 A1

[0728] 实施例 4

[0729] 桃蚜试验 (MYZUPE)

[0730] 溶剂： 7 重量份二甲基甲酰胺

[0731] 乳化剂： 2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0732] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合，并将浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。如果需要添加铵盐或铵盐和渗透剂，则在稀释各个制得的制剂溶液之后分别吸量合适的量。

[0733] 将被桃蚜重度侵染的辣椒 (capsicum annuum) 植株通过喷雾所需浓度的活性化合物制剂进行处理。

[0734] 经所需时间段后，确定以％计的杀灭率。100％意指所有动物被杀死；0％意指没有动物被杀死。

[0735] 实施例 5

[0736] 桃蚜试验，口服 (MYZUPE 0)

[0737] 溶剂： 80 重量份丙酮

[0738] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合，并将浓液用水稀释至所需浓度。

[0739] 在容器中接种所有阶段的桃蚜，通过吮吸所需浓度的活性化合物制剂进行处理。

[0740] 经所需时间段后，确定以％计的药效。100％意指所有蚜虫被杀死；0％意指没有蚜虫被杀死。

[0741] 在本试验中，例如，以下制备实施例的化合物显示出优于现有技术的活性：见表

[0742]

实例	活性化合物浓度，ppm	5 天后的杀灭率， ％
实例 85[a)]	0.032	0
实例 1	0.032	100

[0743] [a)] 参见 EP 0539588 A1

[0744] 实施例 6

[0745] 棉蚜试验 (APHIGO)

[0746] 溶剂： 7 重量份二甲基甲酰胺

[0747] 乳化剂： 2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0748] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合，并将浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。

[0749] 将被棉蚜重度侵染的陆地棉棉叶通过浸入所需浓度的活性化合物制剂中进行处理。

[0750] 经所需时间段后，确定以％计的杀灭率。100％意指所有蚜虫被杀死；0％意指没有蚜虫被杀死。

[0751] 在本试验中，例如，以下制备实施例的化合物显示出良好活性：见表

[0752]

实例	活性化合物浓度，ppm	6 天后的杀灭率，%
实例 85[a)]	4	45
实例 86[a)]	4	10
实例 4	4	99
实例 85[a)]	4 0.8	45 15
实例 1	4 0.8	98 60

[0753] [a)] 参见 EP 0539588 A1

[0754] 实施例 7

[0755] 根结线虫试验 (MELGIN 喷雾处理)

[0756] 溶剂： 80 重量份丙酮

[0757] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合，并将浓液用水稀释至所需浓度。

[0758] 在容器中装入沙、活性化合物溶液、根结线虫卵 / 幼虫的悬浮液和莴苣种子。莴苣种子发芽并且植株发育。在根部，形成瘿瘤。

[0759] 经所需时间段后，通过形成的瘿瘤确定杀线虫活性，以％计。100％意指没有瘿瘤形成 ;0％意指在经处理的植株上形成的瘿瘤数目与未经处理的对照植株上的瘿瘤数目相当。

[0760] 在本试验中，例如，以下制备实施例的化合物显示出优于现有技术的活性 :见表

[0761]

实例	活性化合物浓度，ppm	14 天后的杀灭率，%
实例 85[a)]	20	0
实例 4	20	70

[0762] [a)] 参见 EP 0539588 A1

[0763] 实施例 8

[0764] 铜绿蝇试验 (LUCICU)

[0765] 溶剂： 二甲亚砜

[0766] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合，并将浓液用水稀释至所需浓度。

[0767] 将含有经所需浓度的活性化合物制剂处理的马肉的容器接种铜绿蝇幼虫。

[0768] 经所需时间段后，确定以％计的杀灭率。100％意指所有幼虫被杀死 ;0％表示没有幼虫被杀死。

[0769] 在本试验中，例如，以下制备实施例的化合物显示出优于现有技术的活性 :见表

[0770]

实例	活性化合物浓度，ppm	2 天后的杀灭率，%
实例 85[a)]	4	45
实例 1	4	100

[0771] [a)] 参见 EP 0539588 A1

[0772] 实施例 9

[0773] 猫栉首蚤试验；口服 (CTECFE)

[0774] 溶剂： 二甲亚砜

[0775] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合。将部分浓液用柠檬酸化的牛血进行稀释，制得所需浓度。

[0776] 将 20 只未喂食的成体猫栉首蚤放入顶部与底部用纱布密封的腔室内。将底部用 parafilm 密封的金属圆筒放在该腔室上。该圆筒含有血 / 活性化合物制剂，其可被猫栉首蚤透过 parafilm 膜而吸收。将血温热至 37℃，而放有猫栉首蚤的腔室处于室温。

[0777] 经所需时间段后，确定以％计的杀灭率。100％意指所有蚤被杀死；0％表示没有蚤被杀死。

[0778] 在本试验中，例如，以下制备实施例的化合物显示出优于现有技术的活性：见表

[0779]

实例	活性化合物浓度，ppm	1 天后的杀灭率， %
实例 85[a)]	100	0
实例 86[a)]	100	0
实例 4	100	30

[0780] [a)] 参见 EP 0539588 A1

[0781] 实施例 10

[0782] 微小牛蜱试验 (BOOPMI 注射)

[0783] 溶剂： 二甲亚砜

[0784] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合，并将浓液用溶剂稀释至所需浓度。

[0785] 将活性化合物溶液注射到微小牛蜱腹中并将该动物转移到器皿中并贮存在温度控制室内。

[0786] 经所需时间段后，确定以％计的药效。100％意指没有蜱虫产下任何受精卵。

[0787] 在本试验中，例如，以下制备实施例的化合物显示出优于现有技术的活性：见表

[0788]

实例	活性化合物浓度，ppm	7 天后的杀灭率， %
实例 85[a)]	20	0
实例 86[a)]	20	0
实例 4	20	100

[0789] [a)] 参见 EP 0539588 A1