

(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 101336232 B

(45) 授权公告日 2012. 08. 29

(21) 申请号 200680052410. 4

(22) 申请日 2006. 12. 11

(30) 优先权数据

102005059891. 9 2005. 12. 15 DE

(85) PCT申请进入国家阶段日

2008. 08. 06

(86) PCT申请的申请数据

PCT/EP2006/011911 2006. 12. 11

(87) PCT申请的公布数据

W02007/073856 DE 2007. 07. 05

(73) 专利权人 拜耳农作物科学股份公司

地址 德国蒙海姆

(72) 发明人 R·菲舍尔 S·莱尔 D·福伊希特

E·M·弗兰肯 O·马萨姆

G·伯杰克 C·阿诺德

M·J·希尔斯 H·科恩

C·H·罗辛格 J·迪特根

(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 209/54 (2006. 01)

C07D 307/94 (2006. 01)

C07C 233/45 (2006. 01)

C07C 61/06 (2006. 01)

A01N 43/08 (2006. 01)

A01N 43/38 (2006. 01)

(56) 对比文件

CN 1111477 A, 1995. 11. 15, 说明书第 1 页第 4 行 - 第 1 页最后 1 行 .

WO 2004/024688 A1, 2004. 03. 25, 说明书第 1 页第 22 行 - 第 3 页第 25 行 .

WO 2005/044796 A1, 2005. 05. 19, 说明书第 1 页第 2-8 行, 权利要求 1-18 以及表 1-70.

审查员 赵永江

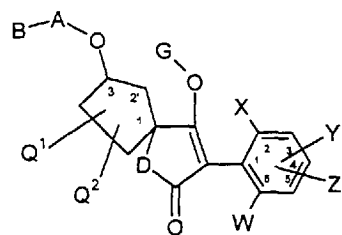
权利要求书 8 页 说明书 126 页

(54) 发明名称

3'-烷氧基螺环戊基取代的特特拉姆酸和特窗酸

(57) 摘要

本发明涉及新的式 (I) 化合物,



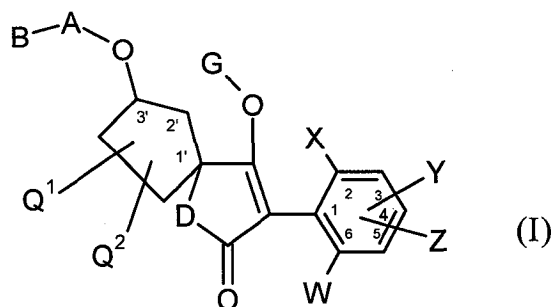
其中 W、X、Y、Z、

(I)

效的方法,即通过加入铵盐和 / 或磷盐、或者加入铵盐和 / 或磷盐与渗透促进剂来实现 ; 相应的药剂 ; 它们的制备方法 ; 以及它们在作物保护中的用途。

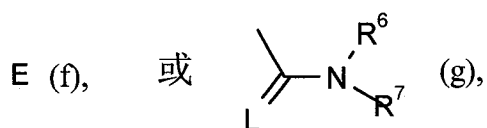
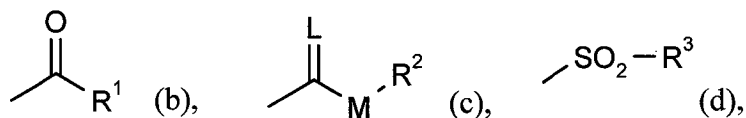
A、B、D、Q¹、Q²和 G 具有说明书中所述含义 ; 涉及其多种制备方法和中间体产物, 及其用作杀虫剂和 / 或除草剂和 / 或杀菌剂的用途 ; 还涉及选择性除草剂, 所述除草剂包括式 (I) 的 3'-烷氧基螺环戊基取代的特特拉姆酸和特窗酸, 以及至少一种改进植物耐受性的化合物。本发明还公开了一种提高含有式 (I) 的 3'-烷氧基螺环戊基取代的特特拉姆酸和特窗酸类药剂的作物保护剂的药

1. 一种式 (I) 化合物



其中

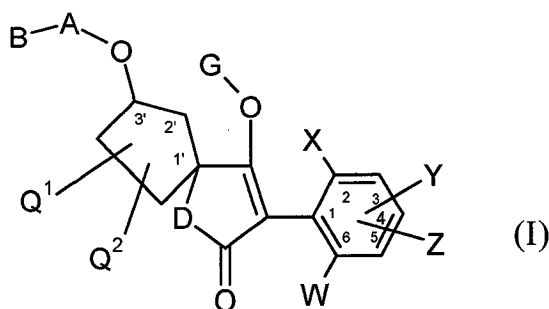
- W 代表甲基、乙基或甲氧基，
 X 代表氯、甲基、乙基或甲氧基，
 Y 在 4-位上代表氯或溴，
 Z 代表氢；
 A 代表 $-\text{CH}_2-$ 或 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ ，
 B 代表氢、甲基、乙基、丙基、甲氧基或环丙基，
 或者 A 代表一个键且 B 代表氢；
 D 代表 NH；
 Q^1 代表氢；
 Q^2 代表氢；
 G 代表氢 (a)，或者代表以下基团之一



其中

- E 代表金属离子，
 L 代表氧，且
 M 代表氧；
 R^1 代表 $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -烷基，
 代表任选被氯单取代的苯基，
 R^2 代表 $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -烷基或 $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -烯基，
 R^3 代表甲基，
 R^6 和 R^7 一起代表一个其中任选地一个亚甲基基团被氧代替的 $\text{C}_5\text{-C}_6$ -亚烷基。

2. 一种式 (I) 化合物，

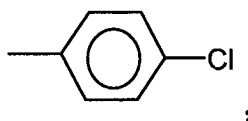


其中

W 代表氢，

X 代表甲基，

Y 在 5- 位上代表基团



Z 在 4-位上代表氢；

A 代表 -CH₂- 或 -CH₂-CH₂-，

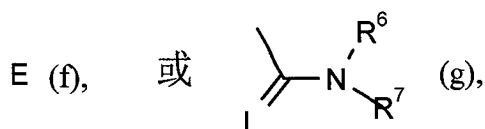
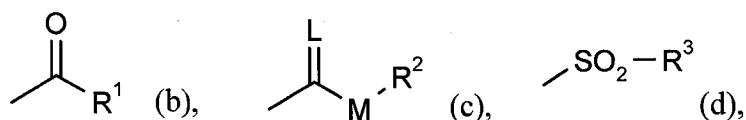
B 代表氢、甲基、乙基、丙基、甲氧基或环丙基，
或者 A 代表一个键且 B 代表氢；

D 代表 NH；

Q¹ 代表氢；

Q² 代表氢；

G 代表氢 (a)，或者代表以下基团之一



其中

E 代表金属离子，

L 代表氧，且

M 代表氧；

R¹ 代表 C₁-C₁₀- 烷基，

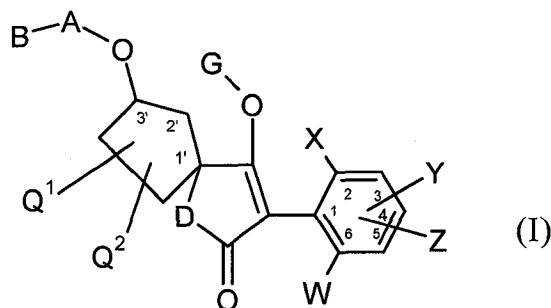
代表任选被氯单取代的苯基，

R² 代表 C₁-C₁₀- 烷基或 C₂-C₁₀- 烯基，

R³ 代表甲基，

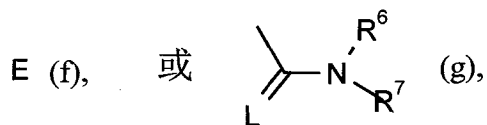
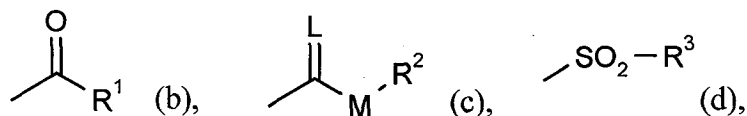
R⁶ 和 R⁷ 一起代表一个其中任选地一个亚甲基基团被氧代替的 C₅-C₆- 亚烷基。

3. 一种式 (I) 化合物,



其中

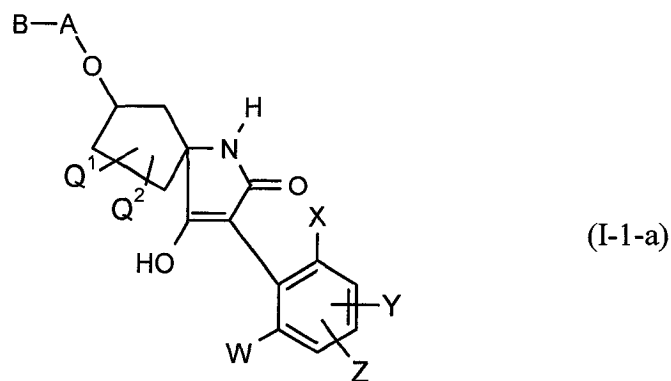
- W 代表甲基或乙基,
 X 代表氯、溴或甲基,
 Y 在 4-位上代表甲基,
 Z 代表氢;
 A 代表 $-\text{CH}_2-$ 或 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$,
 B 代表氢、甲基、乙基、丙基、甲氧基或环丙基,
 或者 A 代表一个键且 B 代表氢;
 D 代表 NH;
 Q^1 代表氢;
 Q^2 代表氢;
 G 代表氢 (a), 或者代表以下基团之一



其中

- E 代表金属离子,
 L 代表氧, 且
 M 代表氧;
 R^1 代表 C_1-C_{10} -烷基,
 代表任选被氯单取代的苯基,
 R^2 代表 C_1-C_{10} -烷基或 C_2-C_{10} -烯基,
 R^3 代表甲基,
 R^6 和 R^7 一起代表一个其中任选地一个亚甲基基团被氧代替的 C_5-C_6 -亚烷基。
 4. 一种用于制备权利要求 1-3 之一的式 (I) 化合物的方法, 其特征在于为获得

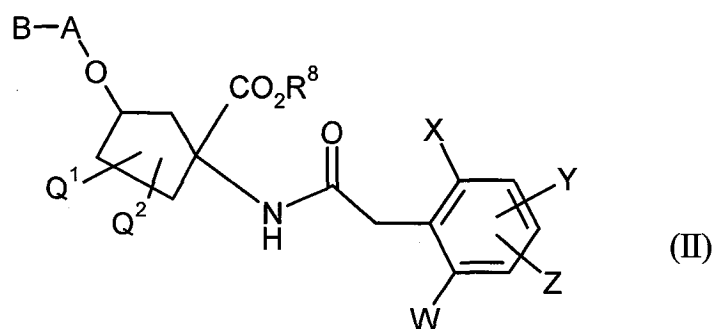
(A) 式 (I-1-a) 化合物,



其中

A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如权利要求 1-3 之一所定义,

在稀释剂的存在下且在碱的存在下,使式 (II) 化合物进行分子内缩合,



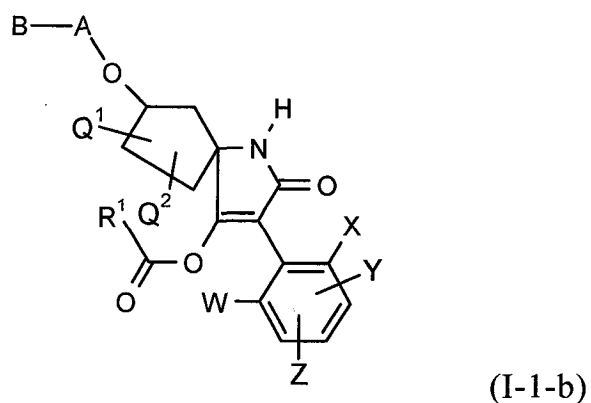
其中

A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如权利要求 1-3 之一所定义,

并且

R⁸ 代表烷基,

(C) 式 (I-1-b) 化合物,



其中

R¹、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如权利要求 1-3 之一所定义,

如果合适在稀释剂的存在下并且如果合适在酸结合剂的存在下,使其中 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如权利要求 1-3 之一所定义的上述式 (I-1-a) 化合物各自

a) 与式 (IV) 化合物反应



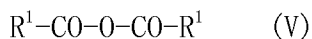
其中

R^1 如权利要求 1-3 之一所定义, 并且

Hal 代表卤素,

或者

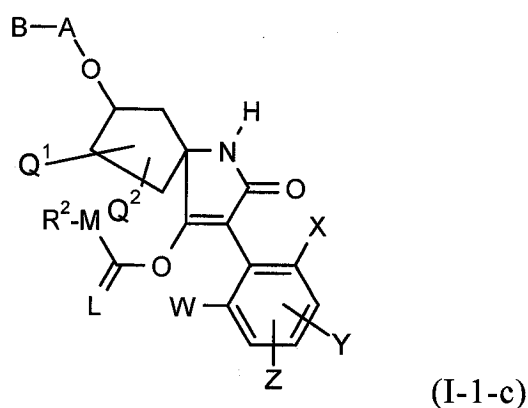
β) 与式 (V) 的羧酸酐反应



其中

R^1 如权利要求 1-3 之一所定义;

(D) 式 (I-1-c) 化合物,

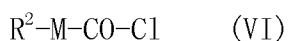


其中

R^2 、A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、M、X、Y 和 Z 如权利要求 1-3 之一所定义, 并且

L 代表氧,

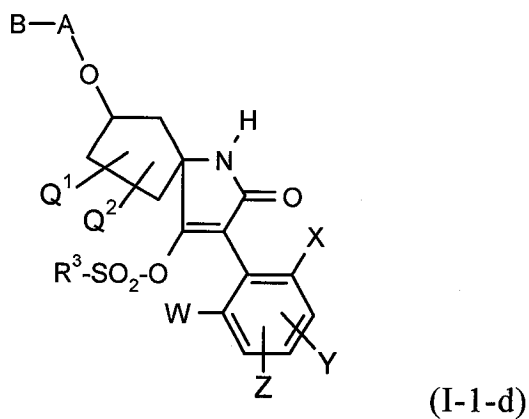
如果合适在稀释剂的存在下且如果合适在酸结合剂的存在下, 使其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y 和 Z 如权利要求 1-3 之一所定义的上述式 (I-1-a) 化合物与式 (VI) 的氯甲酸酯反应



其中

R^2 和 M 如权利要求 1-3 之一所定义;

(F) 式 (I-1-d) 化合物,



其中

R^3 、A、B、W、 Q^1 、 Q^2 、X、Y 和 Z 如权利要求 1-3 之一所定义，

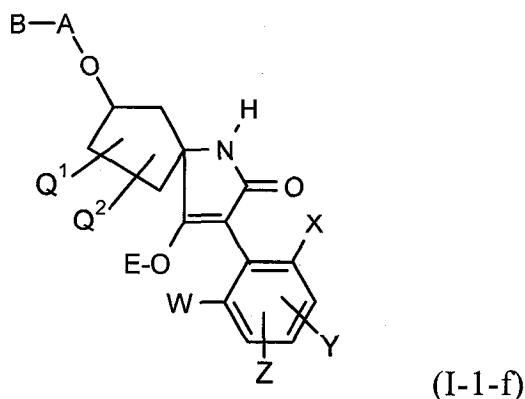
如果合适在稀释剂的存在下并且如果合适在酸结合剂的存在下，使其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y 和 Z 如权利要求 1-3 之一所定义的上述式 (I-1-a) 化合物与式 (VIII) 的磺酰氯反应



其中

R^3 如权利要求 1-3 之一所定义；

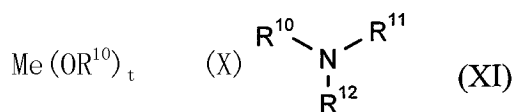
(H) 式 (I-1-f) 化合物，



其中

E、A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y 和 Z 如权利要求 1-3 之一所定义，

如果合适在稀释剂的存在下，使其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y 和 Z 如权利要求 1-3 之一所定义的上述式 (I-1-a) 化合物分别与式 (X) 的金属化合物或 (XI) 的胺反应



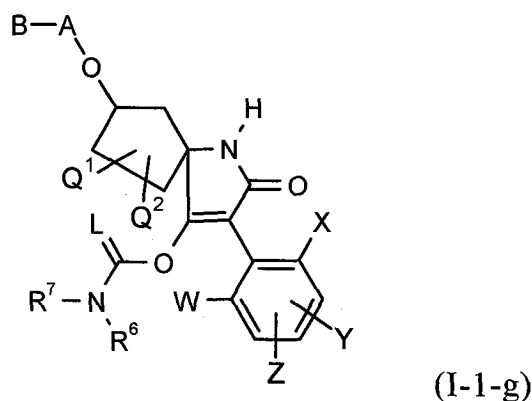
其中

Me 代表一价或二价的金属，

t 代表数字 1 或 2，并且

R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 彼此独立地代表氢或烷基，

(I) 式 (I-1-g) 化合物，



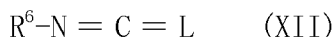
其中

L、 R^6 、 R^7 、A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y 和 Z 如权利要求 1-3 之一所定义，

使其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y 和 Z 如权利要求 1-3 之一所定义的上述式 (I-1-a) 化合物

各自：

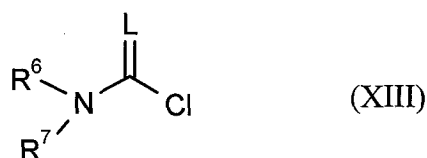
α) 如果合适在稀释剂的存在下并且如果合适在催化剂的存在下,与式 (XII) 的异氰酸酯反应



其中

R^6 和 L 如权利要求 1-3 之一所定义,或者

β) 如果合适在稀释剂的存在下并且如果合适在酸结合剂的存在下,与式 (XIII) 的氨基甲酰氯反应

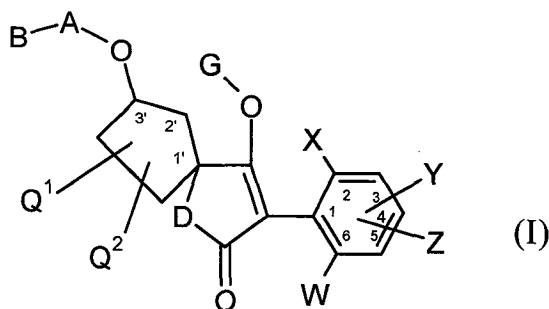


其中

L 、 R^6 和 R^7 如权利要求 1-3 之一所定义。

5. 包括一种有效量的活性化合物结合物的组合物,所述活性化合物结合物含有以下组分

(a') 至少一种式 (I) 化合物,



其中 A 、 B 、 D 、 G 、 Q^1 、 Q^2 、 W 、 X 、 Y 和 Z 如权利要求 1-3 之一所定义,以及

(b') 选自下述化合物的改进作物植物相容性的化合物:吡唑解草酯。

6. 权利要求 1-3 之一的式 (I) 化合物用于制备杀虫剂和 / 或除草剂和 / 或杀菌剂的用途。

7. 一种杀虫剂和 / 或除草剂和 / 或杀菌剂,其特征在于它包括至少一种权利要求 1-3 之一的式 (I) 化合物。

8. 一种用于防治动物有害物和 / 或不想要的植物和 / 或真菌的非治疗目的的方法,其特征在于,使权利要求 1-3 之一的式 (I) 化合物作用于有害物和 / 或其生境。

9. 权利要求 1-3 之一的式 (I) 化合物用于防治动物有害物和 / 或不想要的植物和 / 或真菌的非治疗目的的用途。

10. 一种用于制备杀虫剂和 / 或除草剂和 / 或杀菌剂的方法,其特征在于,将权利要求 1-3 之一的式 (I) 化合物与填充剂和 / 或表面活性剂混合。

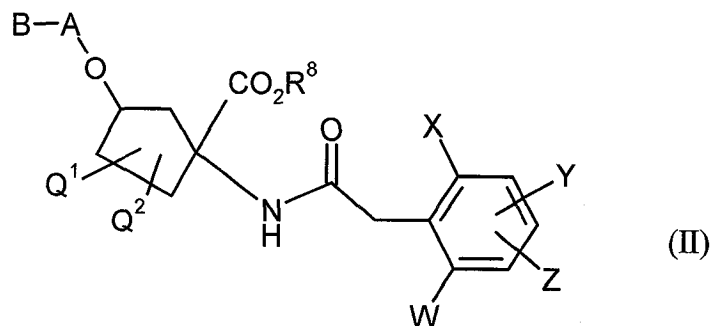
11. 一种用于防治不想要的植物的方法,其特征在于,使权利要求 5 的组合物作用于植物或其生境。

12. 权利要求 5 的组合物用于防治不想要的植物的用途。

13. 一种用于防治不想要的植物的方法,其特征在于,将权利要求 1-3 之一的式 (I) 化

合物和权利要求 5 的改进作物植物相容性的化合物单独地连续紧接地作用于植物或其环境。

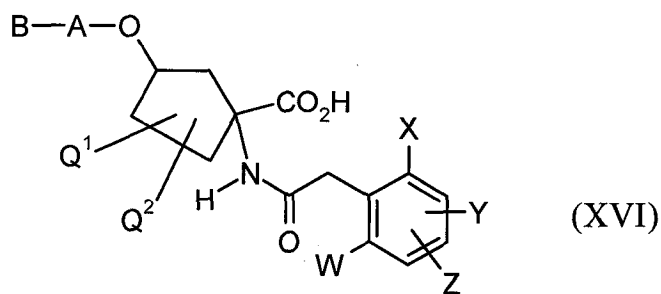
14. 一种式 (II) 化合物,



其中

A 、 B 、 Q^1 、 Q^2 、 W 、 X 、 Y 和 Z 如权利要求 1-3 之一所定义, 且 R^8 如权利要求 4 所定义。

15. 一种式 (XVI) 化合物,



其中

A 、 B 、 Q^1 、 Q^2 、 W 、 X 、 Y 和 Z 如权利要求 1-3 之一所定义。

3' - 烷氧基螺环戊基取代的特特拉姆酸和特窗酸

[0001] 本发明涉及新的 3' - 烷氧基螺环戊基取代的环状酮基烯醇,其多种制备方法及其作为杀虫剂、杀微生物剂和 / 或除草剂的用途。本发明还提供选择性除草组合物,其首先包括 3' - 烷氧基螺环戊基取代的环状酮基烯醇,其次包括一种改进作物植物相容性的化合物。

[0002] 本发明还涉及通过加入铵盐或磷盐以及任选加入渗透剂来增强作物保护组合物的作用,所述作物保护组合物具体包括 3' - 烷氧基螺环戊基取代的特特拉姆酸 (tetramic acid) 和特窗酸;涉及相应的组合物;涉及它们的制备方法并涉及它们在作物保护中作为杀昆虫剂和 / 或杀螨虫剂的用途和 / 或用于预防不想要的作物生长的应用。

[0003] 具有除草、杀昆虫或杀螨虫作用的 1-H- 芳基琥珀酰亚胺衍生物是已知的: EP-A-456 063、EP-A-521 334、EP-A-613 884、EP-A-613 885、WO 95/01358、WO 98/06721、WO 98/25928、WO 99/16748、WO 99/24437、WO 01/17972、WO 05/044791 或 WO 05/048710。

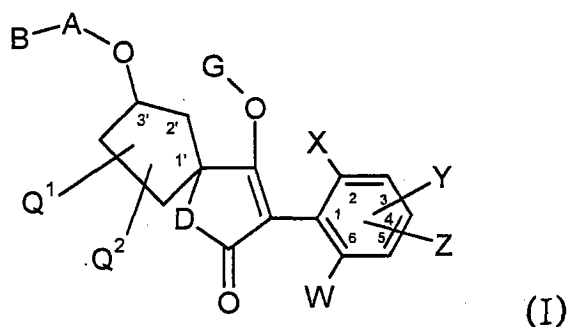
[0004] 同样已知的是烷氧基取代的螺环 1H- 芳基琥珀酰亚胺衍生物:EP-A-596298、WO 95/26954、WO 95/20572、EP-A-0668267、WO 96/25395、WO 96/35664、WO 97/01535、WO 97/02243、WO 97/36868、WO 98/05638、WO 99/43649、WO 99/48869、WO 99/55673、WO 01/23354、WO 01/74770、WO 01/17972、WO 03/013249、WO 04/024688、WO 04/065366、WO 04/080962、WO 04/007448、WO 04/111042、WO 05/044796、WO 05/049569、W005/066125、WO 05/092897、WO 06/000355、WO 06/029799、WO 06/056281、WO 06/056282、WO 06/089633。

[0005] 已知某些 Δ^3 -二氢呋喃-2-酮衍生物具有除草、杀昆虫或杀螨虫特性:EP-A-528 156、EP-A-647 637、WO 95/26954、WO 96/20196、W096/25395、WO 96/35664、WO 97/01535、WO 97/02243、WO 97/36868、WO 98/05638、WO 98/06721、WO 99/16748、WO 98/25928、WO 99/43649、WO 99/48869、WO 99/55673、WO 01/23354、WO 01/74770、WO 01/17972、WO 2004/024688、WO 2004/080962、WO 04/111042、WO 05/092897、W006/000355、WO 06/029799、WO 06/089633。

[0006] 但是,已知化合物的除草的和 / 或杀螨虫的和 / 或杀昆虫的活性和 / 或活性谱和 / 或其与植物——特别是作物植物——的相容性,并不总是足够的。

[0007] 本发明现提供新的式 (I) 化合物

[0008]



[0009] 其中

[0010] W 代表氢、烷基、烯基、炔基、卤素、烷氧基、卤代烷基、卤代烷氧基或氰基,

[0011] X 代表卤素、烷基、烯基、炔基、烷氧基、烷氧基烷氧基、卤代烷基、卤代烷氧基或氰基，

[0012] Y 代表氢、卤素、烷基、烯基、炔基、烷氧基、氰基、卤代烷基、卤代烷氧基，代表各自任选取代的苯基或杂芳基，

[0013] Z 代表氢、卤素、烷基、卤代烷基、氰基、烷氧基或卤代烷氧基，

[0014] A 代表一个任选取代的烷二基基团或者代表任选取代的和 / 或任选被杂原子间隔的环烷基，

[0015] B 代表氢或各自任选取代的烷基、烯基、烷氧基、烷氧基烷氧基、苯基、杂芳基或者代表任选取代的和 / 或任选被多个杂原子和 / 或 C = O 间隔的环烷基，

[0016] 或者，A 代表一个键且 B 代表氢，

[0017] D 代表 NH 或氧，

[0018] Q¹ 代表氢，代表各自任选取代的烷基、烷氧基、烷氧基烷基或烷硫基烷基，代表其中任选地一个亚甲基基团被多个杂原子代替的各自任选取代的环烷基，或者代表任选取代的苯基、杂芳基、苯基烷基或杂芳基烷基，

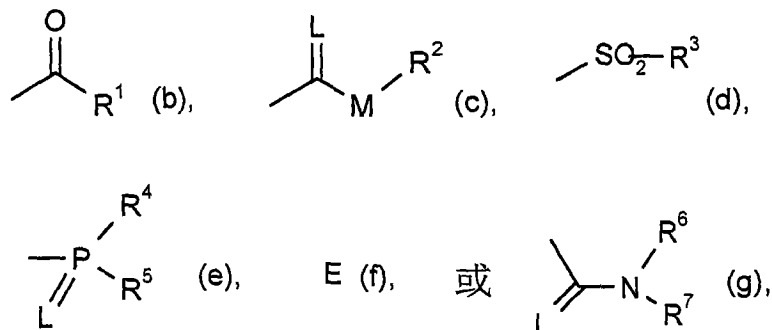
[0019] Q² 代表氢或烷基，

[0020] Q¹ 和 Q² 与它们所连接的碳一起代表一个可任选被杂原子间隔的任选取代的 C₃-C₆- 环，或者

[0021] Q¹ 和 Q² 与它们所连接的多个碳原子一起代表一个可任选被杂原子间隔的任选取代的 C₃-C₆- 环，

[0022] G 代表氢 (a) 或代表以下基团之一，

[0023]



[0024] 其中

[0025] E 代表金属离子或铵离子，

[0026] L 代表氧或硫，

[0027] M 代表氧或硫，

[0028] R¹ 代表各自任选被卤素或氰基取代的烷基、烯基、烷氧基烷基、烷硫基烷基或多烷氧基烷基，或者代表各自任选被卤素、烷基或烷氧基取代的环烷基或杂环基，或者代表各自任选取代的苯基、苯基烷基、杂芳基、苯氧基烷基或杂芳氧基烷基，

[0029] R² 代表各自任选被卤素或氰基取代的烷基、烯基、烷氧基烷基或多烷氧基烷基，或者代表各自任选取代的环烷基、苯基或苯甲基，

[0030] R³、R⁴ 和 R⁵ 彼此独立地代表各自任选被卤素取代的烷基、烷氧基、烷基氨基、二烷基氨基、烷硫基、烯硫基或环烷基硫，或者代表各自任选取代的苯基、苯甲基、苯氧基或苯硫

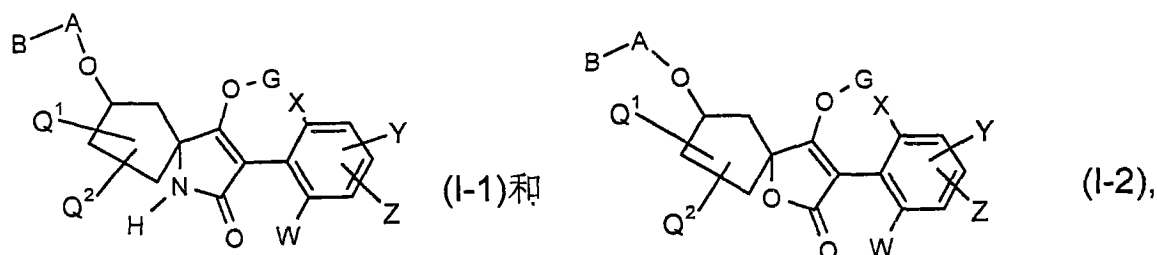
基,

[0031] R^6 和 R^7 彼此独立地代表氢,代表各自任选被卤素或氰基取代的烷基、环烷基、烯基、烷氧基、烷氧基烷基,代表各自任选取代的苯基或苯甲基,或者与它们连接的 N 原子一起形成一个任选含有氧或硫的任选取代的环。

[0032] 根据尤其是取代基的性质,式 (I) 化合物可以旋光异构体的形式或不同组成的异构体混合物的形式存在,所述混合物如果合适可通过常规方式分离。本发明提供纯的异构体和异构体混合物,它们的制备方法及用途,以及含有它们的组合物。但是,为了简便起见,下文中仅称式 (I) 化合物,但其含义既指纯的化合物,如果合适,也指具有不同比例异构体化合物的混合物。

[0033] 当包括 D 为 NH(1) 和 D 为 O(2) 时,得到以下主结构 (I-1) 至 (I-2):

[0034]

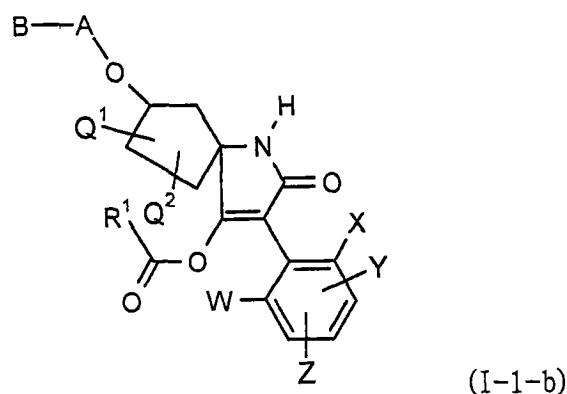
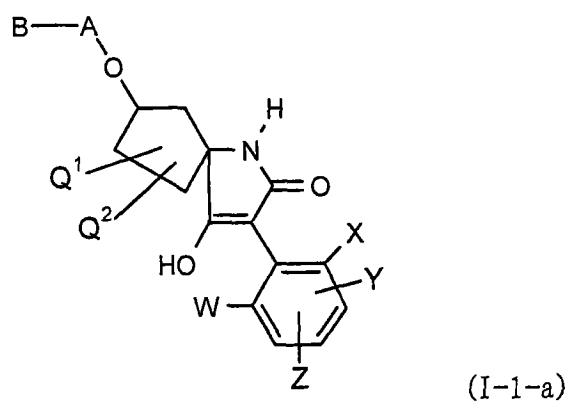


[0035] 其中

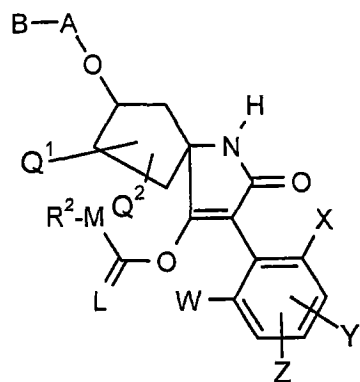
[0036] A、B、G、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y 和 Z 如上文中定义。

[0037] 如果 D 代表 NH(1),将基团 G 的不同含义 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g) 纳入,得到以下主结构 (I-1-a) 至 (I-1-g):

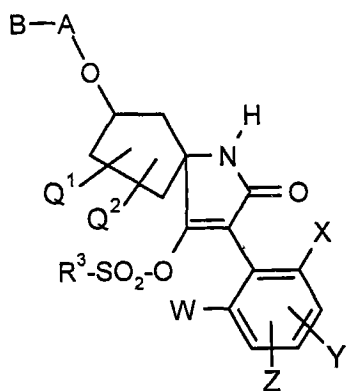
[0038]



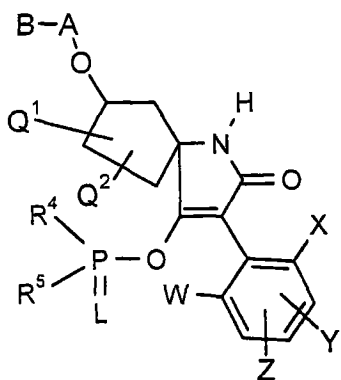
[0039]



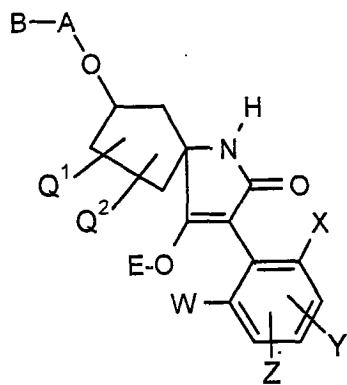
(I-1-c)



(I-1-d)

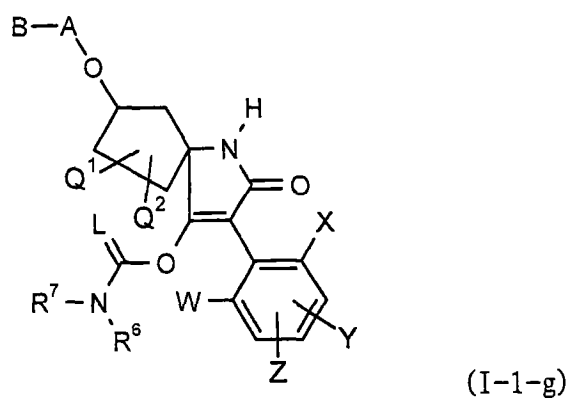


(I-1-e)



(I-1-f)

[0040]

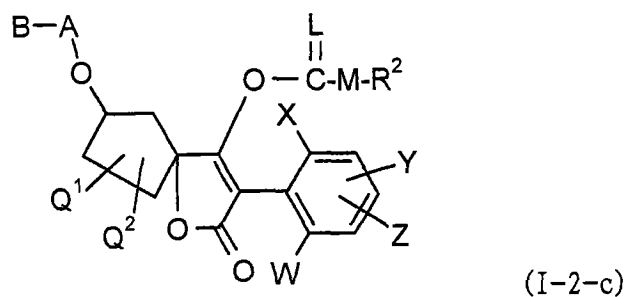
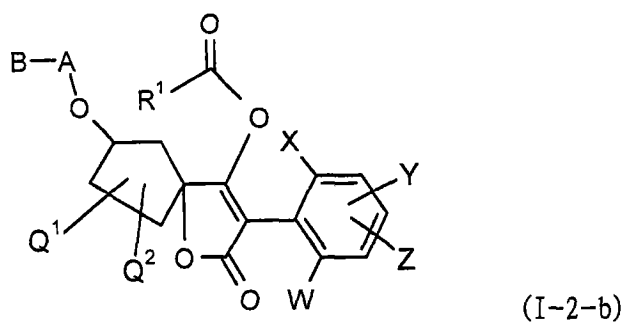
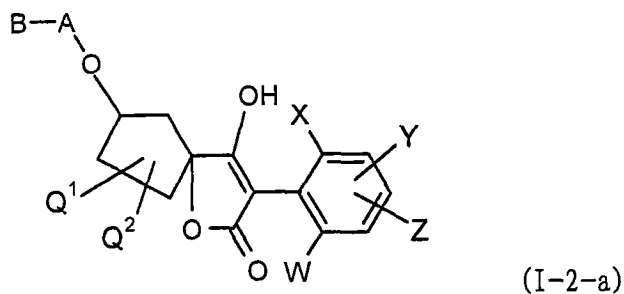


[0041] 其中

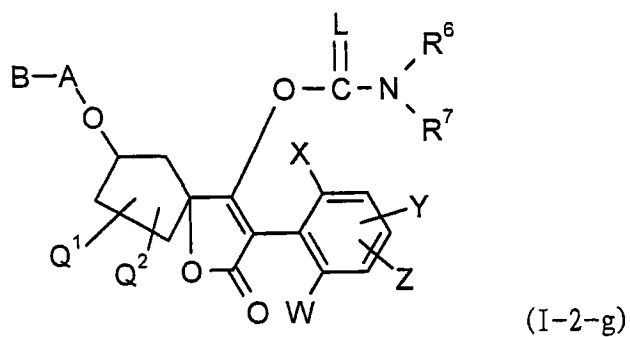
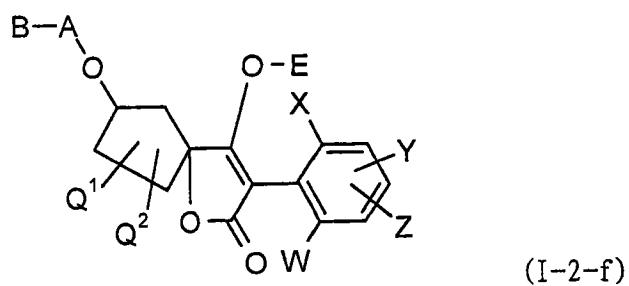
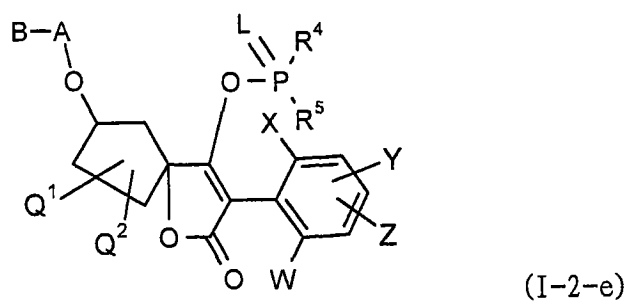
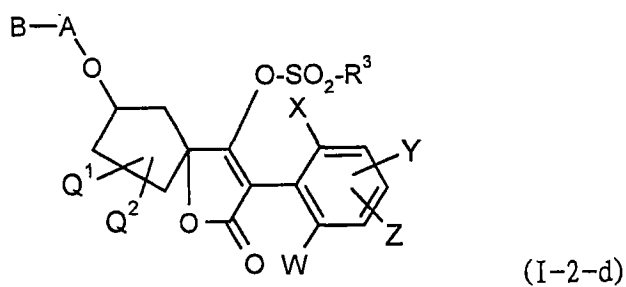
[0042] A、B、E、L、M、Q¹、Q²、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 和 R⁷ 如上文中定义。

[0043] 如果 D 代表 O(2), 将基团 G 的不同含义 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g) 纳入, 得到以下主结构 (I-2-a) 至 (I-2-g) :

[0044]



[0045]



[0046] 其中

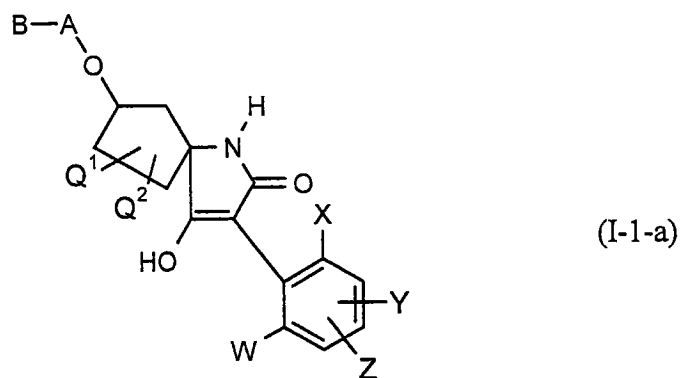
[0047] A、B、E、L、M、Q¹、Q²、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 和 R⁷ 如上文中定义。

[0048] 此外,已发现新的式(I)化合物可通过下述方法获得:

[0049] (A) 当式(II)化合物在稀释剂的存在下且在碱的存在下进行分子

[0050] 内缩合时获得式(I-1-a)的化合物

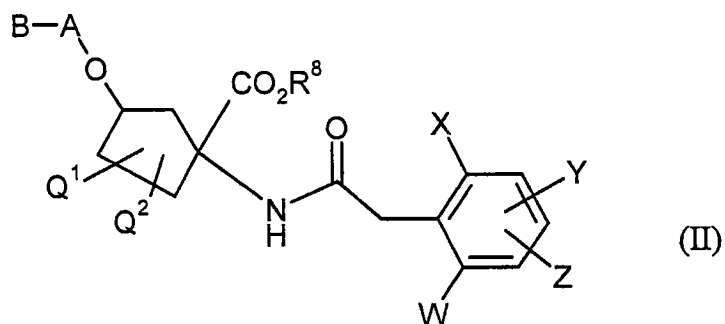
[0051]



[0052] 其中

[0053] A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如上文中定义，

[0054]



[0055] 其中

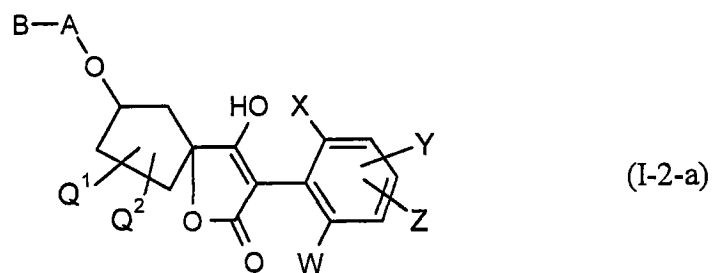
[0056] A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如上文中定义，

[0057] 并且

[0058] R⁸ 代表烷基（优选 C₁-C₆-烷基）。

[0059] (B) 另外，已发现当式 (III) 化合物在稀释剂的存在下且在碱的存在下进行分子内缩合时获得式 (I-2-a) 化合物

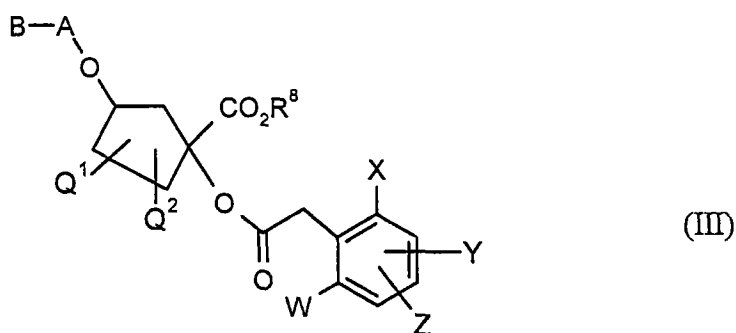
[0060]



[0061] 其中

[0062] A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如上文中定义，

[0063]



[0064] 其中

[0065] A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z 和 R⁸ 如上文中定义。

[0066] 另外,还已发现

[0067] (C) 当其中 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如上文中定义的上述式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物各自 α) 与式 (IV) 化合物或 β) 与式 (V) 的羧酸酐反应时,获得其中 R¹、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如上文中定义的上述式 (I-1-b) 至 (I-2-b) 化合物,该反应如果合适在稀释剂的存在下并且如果合适在酸结合剂的存在下进行

[0068]



[0069] 其中

[0070] R¹ 如上文定义,并且

[0071] Hal 代表卤素 (特别是氯或溴),

[0072] R¹-CO-O-CO-R¹ (V)

[0073] 其中

[0074] R¹ 如上文中定义;

[0075] (D) 当其中 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如上文中定义的上述式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物各自与式 (VI) 的氯甲酸酯或氯甲酸硫酯反应时,获得其中 R²、A、B、Q¹、Q²、W、M、X、Y 和 Z 如上文中定义且 L 代表氧的上述式 (I-1-c) 至 (I-2-c) 化合物,该反应如果合适在稀释剂的存在下并且如果合适在酸结合剂的存在下进行

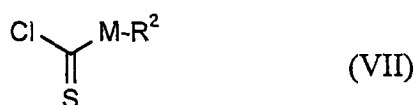
[0076] R²-M-CO-Cl (VI)

[0077] 其中

[0078] R² 和 M 如上文定义;

[0079] (E) 当其中 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如上文中定义的上述式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物各自与式 (VII) 的氯代单硫代甲酸酯或氯代二硫代甲酸酯反应时,获得其中 R²、A、B、Q¹、Q²、W、M、X、Y 和 Z 如上文中定义且 L 代表硫的上述式 (I-1-c) 至 (I-2-c) 化合物,该反应如果合适在稀释剂的存在下并且如果合适在酸结合剂的存在下进行

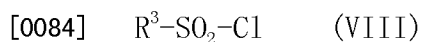
[0080]



[0081] 其中

[0082] M 和 R² 如上文定义;

[0083] (F) 当其中 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如上文中定义的上述式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物各自与式 (VIII) 的磺酰氯反应时, 获得其中 R³、A、B、W、Q¹、Q²、X、Y 和 Z 如上文中定义的上述式 (I-1-d) 至 (I-2-d) 化合物, 该反应如果合适在稀释剂的存在并且如果合适在酸结合剂的存在下进行

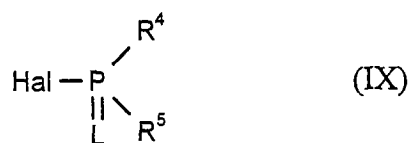


[0085] 其中

[0086] R³ 如上文定义;

[0087] (G) 当其中 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如上文中定义的上述式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物各自与式 (IX) 的磷化合物反应时, 获得其中 L、R⁴、R⁵、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如上文中定义的上述式 (I-1-e) 至 (I-2-e) 化合物, 该反应如果合适在稀释剂的存在下并且如果合适在酸结合剂的存在下进行

[0088]

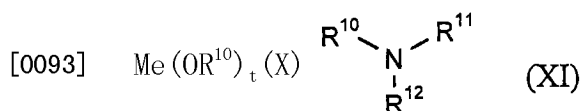


[0089] 其中

[0090] L、R⁴ 和 R⁵ 如上文定义, 并且

[0091] Hal 代表卤素 (特别是氯或溴),

[0092] (H) 当其中 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如上文中定义的上述式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物各自与式 (X) 的金属化合物或式 (XI) 的胺反应时, 获得其中 E、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如上文中定义的上述式 (I-1-f) 至 (I-2-f) 化合物, 该反应如果合适在稀释剂的存在下进行



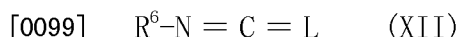
[0094] 其中

[0095] Me 代表一价或二价的金属 (优选为碱金属或碱土金属, 例如锂、钠、钾、镁或钙),

[0096] t 代表数字 1 或 2, 并且

[0097] R¹⁰、R¹¹、R¹² 彼此独立地代表氢或烷基 (优选为 C₁-C₈-烷基),

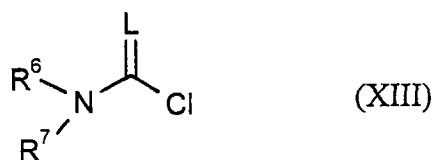
[0098] (I) 当其中 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如上文中定义的上述式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物各自 α) 如果合适在稀释剂的存在下并且如果合适在催化剂的存在下与式 (XII) 的异氰酸酯或异硫氰酸酯反应或者 β) 如果合适在稀释剂的存在下并且如果合适在酸结合剂的存在下与式 (XIII) 的氨基甲酰氯或硫代氨基甲酰氯反应时, 获得其中 L、R⁶、R⁷、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如上文中定义的上述式 (I-1-g) 至 (I-2-g) 化合物



[0100] 其中

[0101] R⁶ 和 L 如上文定义,

[0102]



[0103] 其中

[0104] L、R⁶ 和 R⁷ 如上文中定义。

[0105] 此外,已发现式 (I) 的新化合物作为农药——优选作为杀昆虫剂、杀螨虫剂和 / 或杀菌剂和 / 或除草剂——时非常有效,并常常还具有很好的植物耐受性,特别是作物植物耐受性。

[0106] 令人惊讶地,现还已发现某些取代的环状酮基烯醇在与下述改进作物植物相容性的化合物 (安全剂 / 解毒剂) 一起使用时,能够有效地预防对作物植物的损害并可以特别有利的方式用作广谱结合物制剂,用于选择性防治有益植物作物中的不想要的植物,所述有益植物作物例如谷物以及玉米、大豆和稻。

[0107] 本发明还提供包括有效量的一种活性化合物结合物的选择性除草组合物,所述结合物含有以下组分,

[0108] (a') 至少一种式 (I) 化合物,其中 A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 如上定义,

[0109] 以及

[0110] (b') 至少一种选自下述化合物的可改进作物植物相容性的化合物:

[0111] 4-二氯乙酰基-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷 (AD-67, MON-4660)、1-二氯乙酰基六氢-3,3,8a-三甲基吡咯并[1,2-a]嘧啶-6(2H)-酮 (dicyclonon, BAS-145138)、

[0112] 4-二氯乙酰基-3,4-二氢-3-甲基-2H-1,4-苯并噁嗪 (解草嗪 (benoxacor))、

[0113] 5-氯喹啉-8-氧基乙酸-1-甲基己酯 (解草酯 (cloquintocet-mexyl))——参见 EP-A-86750、EP-A-94349、EP-A-191736、EP-A-492366 中也相关化合物)、

[0114] 3-(2-氯苯甲基)-1-(1-甲基-1-苯基乙基)脲 (苄草隆 (cumyluron))、

[0115] α-(氰基甲氧亚氨基)苯乙腈 (解草胺腈 (cyometrinil))、

[0116] 2,4-二氯苯氧基乙酸 (2,4-D)、

[0117] 4-(2,4-二氯苯氧基)丁酸 (2,4-DB)、

[0118] 1-(1-甲基-1-苯基乙基)-3-(4-甲基苯基)脲 (杀草隆 (daimuron、dymron))、

[0119] 3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸 (麦草畏 (dicamba))、

[0120] 哌啶-1-硫代羧酸 S-1-甲基-1-苯基乙酯 (哌草丹 (dimepiperate))、

[0121] 2,2-二氯-N-(2-氧代-2-(2-丙烯基氨基)乙基)-N-(2-丙烯基)乙酰胺 (DKA-24)、

[0122] 2,2-二氯-N,N'-二-2-丙烯基乙酰胺 (烯丙酰草胺 (dichlormid))、

[0123] 4,6-二氯-2-苯基嘧啶 (解草啶 (fencloirim))、

[0124] 1-(2,4-二氯苯基)-5-三氯甲基-1H-1,2,4-三唑-3-羧酸乙酯 (解草唑 (fenchlorazole-ethyl))——参见 EP-A-174562 和 EP-A-346620 中也相关化合物)、

[0125] 2-氯-4-三氟甲基噻唑-5-羧酸苯甲酯 (解草胺 (flurazole))、

[0126] 4-氯-N-(1,3-二氧戊环-2-基甲氧基)-α-三氟乙酰苯酮肟 (氟草肟 (fluxofenim))、

[0127] 3-二氯乙酰基-5-(2-呋喃基)-2,2-二甲基噁唑烷 (解草噁唑 (furilazole)),

MON-13900)、

[0128] 4,5-二氢-5,5-二苯基-3-异噁唑羧酸乙酯(双苯噁唑酸(isoxadifen-ethyl)——参见 W0-A-95/07897 中也相关化合物)、

[0129] 3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸 1-(乙氧基羰基)乙酯(lactidichlor)、

[0130] (4-氯-邻甲苯氧基)乙酸(MCPA)、

[0131] 2-(4-氯-邻甲苯氧基)丙酸(2-甲-4-氯丙酸(mecoprop))、

[0132] 1-(2,4-二氯苯基)-4,5-二氢-5-甲基-1H-吡唑-3,5-二羧酸二乙酯(吡唑解草酯(mefenpyr-diethyl)——参见 W0-A-91/07874 中也相关化合物)、

[0133] 2-二氯甲基-2-甲基-1,3-二氧戊环(MG-191)、

[0134] 2-丙烯基-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷-4-二硫代羧酸酯(MG-838)、

[0135] 1,8-萘二甲酸酐、

[0136] α -(1,3-二氧戊环-2-基甲氧亚氨基)苯乙腈(解草腈(oxabetrinil))、

[0137] 2,2-二氯-N-(1,3-二氧戊环-2-基甲基)-N-(2-丙烯基)乙酰胺(PPG-1292)、

[0138] 3-二氯乙酰基-2,2-二甲基噁唑烷(R-28725)、

[0139] 3-二氯乙酰基-2,2,5-三甲基噁唑烷(R-29148)、

[0140] 4-(4-氯-邻甲苯基)丁酸、

[0141] 4-(4-氯苯氧基)丁酸、

[0142] 二苯基甲氧基乙酸、

[0143] 二苯基甲氧基乙酸甲酯、

[0144] 二苯基甲氧基乙酸乙酯、

[0145] 1-(2-氯苯基)-5-苯基-1H-吡唑-3-羧酸甲酯、

[0146] 1-(2,4-二氯苯基)-5-甲基-1H-吡唑-3-羧酸乙酯、

[0147] 1-(2,4-二氯苯基)-5-异丙基-1H-吡唑-3-羧酸乙酯、

[0148] 1-(2,4-二氯苯基)-5-(1,1-二甲基乙基)-1H-吡唑-3-羧酸乙酯、

[0149] 1-(2,4-二氯苯基)-5-苯基-1H-吡唑-3-羧酸乙酯(参见 EP-A-269806 和 EP-A-333131 中也相关化合物)、

[0150] 5-(2,4-二氯苯基)-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯、

[0151] 5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯、

[0152] 5-(4-氟苯基)-5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯(参见 W0-A-91/08202 中也相关化合物)、

[0153] 5-氯喹啉-8-氧基乙酸 1,3-二甲基丁-1-基酯、

[0154] 5-氯喹啉-8-氧基乙酸 4-烯丙氧基丁酯、

[0155] 5-氯喹啉-8-氧基乙酸 1-烯丙氧基丙-2-基酯、

[0156] 5-氯喹啉-8-氧基乙酸甲酯、

[0157] 5-氯喹啉-8-氧基乙酸乙酯、

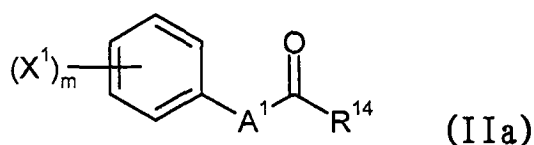
[0158] 5-氯喹啉-8-氧基乙酸烯丙酯、

[0159] 5-氯喹啉-8-氧基乙酸 2-氧代丙-1-基酯、

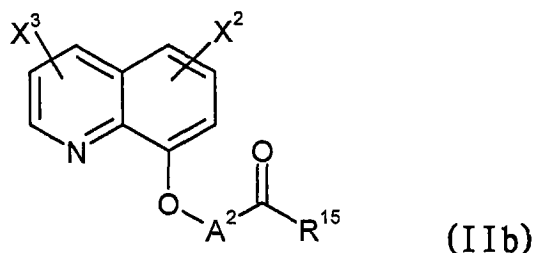
[0160] 5-氯喹啉-8-氧基丙二酸二乙酯、

[0161] 5-氯喹啉-8-氧基丙二酸二烯丙酯、

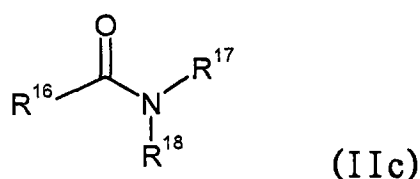
- [0162] 5-氯喹啉-8-氧基丙二酸二乙酯(参见 EP-A-582198 中也相关化合物)、
 [0163] 4-羧基苯并二氢吡喃-4-基乙酸(AC-304415, 参见 EP-A-613618)、
 [0164] 4-氯苯氧基乙酸、
 [0165] 3,3'-二甲基-4-甲氧基二苯酮、
 [0166] 1-溴-4-氯甲基磺酰基苯、
 [0167] 1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-3-甲基脲(即 N-(2-甲氧基苯甲酰基)-4-[(甲基氨基羰基)氨基]苯磺酰胺)、
 [0168] 1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-3,3-二甲基脲、
 [0169] 1-[4-(N-4,5-二甲基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-3-甲基脲、
 [0170] 1-[4-(N-萘基氨基磺酰基)苯基]-3,3-二甲基脲、
 [0171] N-(2-甲氧基-5-甲基苯甲酰基)-4-(环丙基氨基羰基)苯磺酰胺, 和/或以下由通式定义的化合物之一,
 [0172] 通式 (IIa)
 [0173]



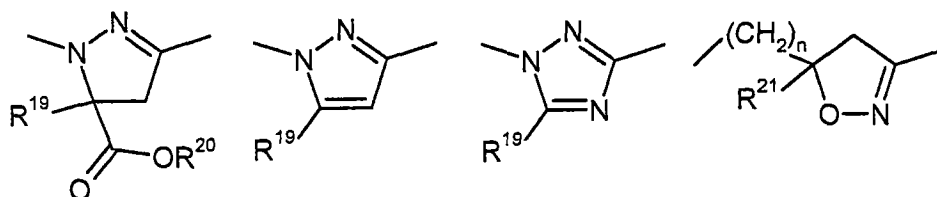
- [0174] 或通式 (IIb)
 [0175]



- [0176] 或通式 (IIc)
 [0177]



- [0178] 其中
 [0179] m 代表数字 0、1、2、3、4 或 5,
 [0180] A¹ 代表以下所示二价杂环基团之一
 [0181]



- [0182] n 代表数字 0、1、2、3、4 或 5,

[0183] A^2 代表任选被 C_1-C_4 烷基和 / 或 C_1-C_4 烷氧基羰基和 / 或 C_1-C_4 烯氧基羰基取代的具有 1 或 2 个碳原子的烷二基,

[0184] R^{14} 代表羟基、巯基、氨基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷基氨基或二- $(C_1-C_4$ 烷基)氨基,

[0185] R^{15} 代表羟基、巯基、氨基、 C_1-C_7 烷氧基、 C_1-C_6 烯氧基、 C_1-C_6 烯氧基- C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷基氨基或二- $(C_1-C_4$ 烷基)氨基,

[0186] R^{16} 代表任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C_1-C_4 烷基,

[0187] R^{17} 代表氢、各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基或 C_2-C_6 炔基、 C_1-C_4 烷氧基- C_1-C_4 烷基、二氧戊环基- C_1-C_4 烷基、呋喃基、呋喃基- C_1-C_4 烷基、噻吩基、噻唑基、哌啶基,或者任选被氟、氯和 / 或溴或 C_1-C_4 烷基取代的苯基,

[0188] R^{18} 代表氢、各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基或 C_2-C_6 炔基、 C_1-C_4 烷氧基- C_1-C_4 烷基、二氧戊环基- C_1-C_4 烷基、呋喃基、呋喃基- C_1-C_4 烷基、噻吩基、噻唑基、哌啶基,或者任选被氟、氯和 / 或溴或 C_1-C_4 烷基取代的苯基, R^{17} 和 R^{18} 还一起代表各自任选被 C_1-C_4 烷基、苯基、呋喃基、稠合苯环或被两个取代基取代的 C_3-C_6 烷二基或 C_2-C_5 氧杂烷二基,所述两个取代基与它们所连接的 C 原子一起形成 5 或 6 元碳环,

[0189] R^{19} 代表氢、氰基、卤素,或者代表各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C_1-C_4 烷基、 C_3-C_6 环烷基或苯基,

[0190] R^{20} 代表氢,各自任选被羟基、氰基、卤素或 C_1-C_4 烷氧基取代的 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 环烷基或三- $(C_1-C_4$ 烷基)甲硅烷基,

[0191] R^{21} 代表氢、氰基、卤素,或者代表各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C_1-C_4 烷基、 C_3-C_6 环烷基或苯基,

[0192] X^1 代表硝基、氰基、卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 卤代烷氧基,

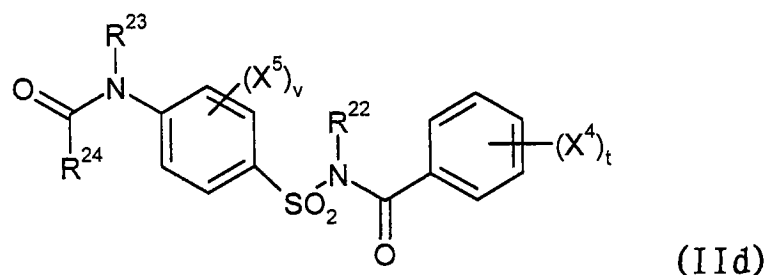
[0193] X^2 代表氢、氰基、硝基、卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 卤代烷氧基,

[0194] X^3 代表氢、氰基、硝基、卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 卤代烷氧基,

[0195] 和 / 或以下由通式定义的化合物,

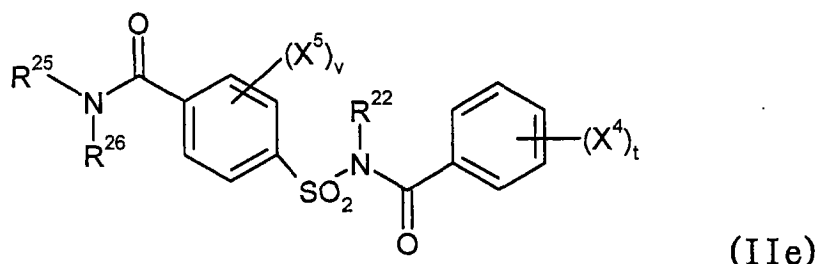
[0196] 通式 (IIId)

[0197]



[0198] 或通式 (IIe)

[0199]



[0200] 其中

[0201] t 代表数字 0、1、2、3、4 或 5，

[0202] v 代表数字 0、1、2、3、4 或 5，

[0203] R^{22} 代表氢或 C_1 - C_4 烷基，

[0204] R^{23} 代表氢或 C_1 - C_4 烷基，

[0205] R^{24} 代表氢、各自任选被氰基、卤素或 C_1 - C_4 烷氧基取代的 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 烷基氨基或二 (C_1 - C_4 烷基) 氨基，或者各自任选被氰基、卤素或 C_1 - C_4 烷基取代的 C_3 - C_6 环烷基、 C_3 - C_6 环烷基氧基、 C_3 - C_6 环烷基硫基或 C_3 - C_6 环烷基氨基，

[0206] R^{25} 代表氢，任选被氰基、羟基、卤素或 C_1 - C_4 烷氧基取代的 C_1 - C_6 烷基，各自任选被氰基或卤素取代的 C_3 - C_6 烯基或 C_3 - C_6 炔基，或者任选被氰基、卤素或 C_1 - C_4 烷基取代的 C_3 - C_6 环烷基，

[0207] R^{26} 代表氢，任选被氰基、羟基、卤素或 C_1 - C_4 烷氧基取代的 C_1 - C_6 烷基，各自任选被氰基或卤素取代的 C_3 - C_6 烯基或 C_3 - C_6 炔基，任选被氰基、卤素或 C_1 - C_4 烷基取代的 C_3 - C_6 环烷基，或者任选被硝基、氰基、卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基取代的苯基，或者与 R^{25} 一起代表各自任选被 C_1 - C_4 烷基取代的 C_2 - C_6 烷二基或 C_2 - C_5 氧杂烷二基，

[0208] X^4 代表硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、甲酰基、氨基磺酰基、羟基、氨基、卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基，并且

[0209] X^5 代表硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、甲酰基、氨基磺酰基、羟基、氨基、卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基。

[0210] 式 (I) 提供了本发明化合物的宽泛定义。上文及下文给出的结构式中所列的取代基或基团范围的优选说明如下：

[0211] W 优选代表氢、 C_1 - C_6 - 烷基、 C_2 - C_6 - 烯基、 C_2 - C_6 - 炔基、卤素、 C_1 - C_6 - 烷氧基、 C_1 - C_4 - 卤代烷基、 C_1 - C_4 - 卤代烷氧基或氰基，

[0212] X 优选代表卤素、 C_1 - C_6 - 烷基、 C_2 - C_6 - 烯基、 C_2 - C_6 - 炔基、 C_1 - C_6 - 烷氧基、 C_1 - C_6 - 烷氧基- 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，

[0213] Y 优选代表氢、卤素、 C_1 - C_6 - 烷基、 C_2 - C_6 - 烯基、 C_2 - C_6 - 炔基、 C_1 - C_6 - 烷氧基、氰基、 C_1 - C_4 - 卤代烷基、卤代烷氧基，代表被 V^1 和 V^2 取代的苯基或吡啶基，

[0214] V^1 优选代表卤素、 C_1 - C_{12} - 烷基、 C_1 - C_6 - 烷氧基、 C_1 - C_4 - 卤代烷基、 C_1 - C_4 - 卤代烷氧基、氰基或硝基，

[0215] V^2 优选代表氢、卤素、 C_1 - C_6 - 烷基、 C_1 - C_6 - 烷氧基或 C_1 - C_4 - 卤代烷基，

[0216] V^1 和 V^2 一起优选代表可任选被卤素和 / 或 C_1 - C_2 - 烷基取代并且可任选被一个或两个氧原子间隔的 C_3 - C_4 - 烷二基，

[0217] Z 优选代表氢、卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、氰基、 C_1-C_6 -烷氧基或 C_1-C_4 -卤代烷氧基，

[0218] A 优选代表任选被 C_1-C_4 -烷基取代的 C_1-C_4 -烷二基基团，或者代表其中任选地一个亚甲基基团被氧代替的任选被 C_1-C_4 -烷基取代的 C_5-C_8 -环烷基，

[0219] B 优选代表氢或者代表各自任选被卤素取代的 C_1-C_8 -烷基、 C_2-C_8 -烯基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷氧基-双- C_1-C_4 -烷氧基，代表任选被卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、氰基或硝基取代的苯基，代表任选被卤素、 C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_2 -卤代烷基取代的吡啶基、嘧啶基、噻唑基或噻吩基，或者代表任选被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_2 -卤代烷基取代的 C_3-C_8 -环烷基，其中任选地一个或两个不直接相邻的亚甲基被氧代替，两个亚甲基基团被 $-O-CO-$ 基团代替或三个亚甲基基团被 $-O-CO-O-$ 基团代替，

[0220] 或者 A 优选代表一个键且 B 代表氢，

[0221] D 优选代表 NH 或氧，

[0222] Q^1 优选代表氢，或者代表各自任选被卤素取代的 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷硫基- C_1-C_4 -烷基，或者代表任选被卤素、 C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_4 -烷氧基取代的 C_3-C_6 -环烷基，其中任选一个亚甲基基团被氧代替，或者代表苯基、苯基- C_1-C_2 -烷基或杂芳基，它们各自任选被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基或 C_1-C_4 -卤代烷氧基单取代或二取代，

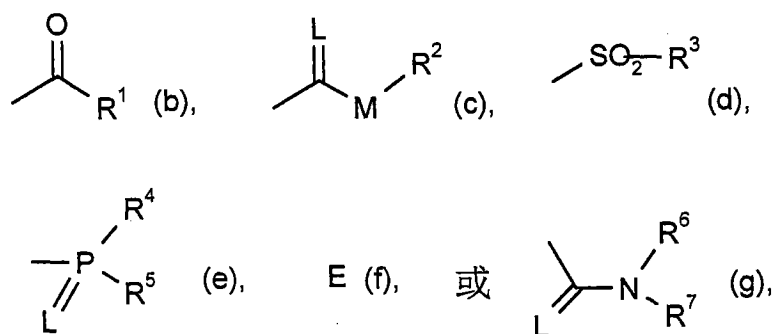
[0223] Q^2 优选代表氢或 C_1-C_6 -烷基，或者

[0224] Q^1 和 Q^2 与它们连接的碳一起优选代表一个任选被氟、氯、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基或三氟甲基单取代或二取代、且其中任选地一个亚甲基基团可被氧代替的 C_3-C_6 -环，或者

[0225] Q^1 和 Q^2 与它们连接的多个碳原子一起优选代表一个任选被氟、氯、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基或三氟甲基单取代或二取代、且其中任选地一个亚甲基基团可被氧代替的 C_3-C_6 -环。

[0226] G 优选代表氢 (a) 或代表以下基团之一，

[0227]



[0228] 其中

[0229] E 代表金属离子或铵离子，

[0230] L 代表氧或硫，且

[0231] M 代表氧或硫，

[0232] R^1 优选代表各自任选被卤素或氰基取代的 C_1-C_{20} -烷基、 C_2-C_{20} -烯基、 C_1-C_8 -烷

氧基 $-C_1-C_8-$ 烷基、 C_1-C_8- 烷硫基 $-C_1-C_8-$ 烷基或多 $-C_1-C_8-$ 烷氧基 $-C_1-C_8-$ 烷基, 或者代表任选被卤素、 C_1-C_6- 烷基或 C_1-C_6- 烷氧基取代的 C_3-C_8- 环烷基, 其中任选地一个或两个不直接相邻的亚甲基基团被氧和 / 或硫代替,

[0233] 优选代表任选被卤素、氰基、硝基、 C_1-C_6- 烷基、 C_1-C_6- 烷氧基、 C_1-C_6- 卤代烷基、 C_1-C_6- 卤代烷氧基、 C_1-C_6- 烷硫基或 C_1-C_6- 烷基磺酰基取代的苯基,

[0234] 优选代表任选被卤素、硝基、氰基、 C_1-C_6- 烷基、 C_1-C_6- 烷氧基、 C_1-C_6- 卤代烷基或 C_1-C_6- 卤代烷氧基取代的苯基 $-C_1-C_6-$ 烷基,

[0235] 优选代表任选被卤素或 C_1-C_6- 烷基取代的、具有一个或两个选自氧、硫和氮的杂原子的五元或六元杂芳环,

[0236] 优选代表任选卤素或 C_1-C_6- 烷基取代的苯氧基 $-C_1-C_6-$ 烷基, 或者

[0237] 优选代表任选被卤素、氨基或 C_1-C_6- 烷基取代的、具有一个或两个选自氧、硫和氮的杂原子的五元或六元杂芳氧基 $-C_1-C_6-$ 烷基,

[0238] R^2 优选代表各自任选被卤素或氰基取代的 $C_1-C_{20}-$ 烷基、 $C_2-C_{20}-$ 烯基、 C_1-C_8- 烷氧基 $-C_2-C_8-$ 烷基或多 $-C_1-C_8-$ 烷氧基 $-C_2-C_8-$ 烷基, 优选地代表任选被卤素、 C_1-C_6- 烷基或 C_1-C_6- 烷氧基取代的 C_3-C_8- 环烷基, 或者

[0239] 优选代表各自任选被卤素、氰基、硝基、 C_1-C_6- 烷基、 C_1-C_6- 烷氧基、 C_1-C_6- 卤代烷基或 C_1-C_6- 卤代烷氧基取代的苯基或苯甲基,

[0240] R^3 优选代表任选被卤素取代的 C_1-C_8- 烷基, 或者各自任选被卤素、 C_1-C_6- 烷基、 C_1-C_6- 烷氧基、 C_1-C_4- 卤代烷基、 C_1-C_4- 卤代烷氧基、氰基或硝基取代的苯基或苯甲基,

[0241] R^4 和 R^5 彼此独立地优选代表各自任选被卤素取代的 C_1-C_8- 烷基、 C_1-C_8- 烷氧基、 C_1-C_8- 烷基氨基、二- $(C_1-C_8-$ 烷基) 氨基、 C_1-C_8- 烷硫基或 C_3-C_8- 烯硫基, 或者代表各自任选被卤素、硝基、氰基、 C_1-C_4- 烷氧基、 C_1-C_4- 卤代烷氧基、 C_1-C_4- 烷硫基、 C_1-C_4- 卤代烷硫基、 C_1-C_4- 烷基或 C_1-C_4- 卤代烷基取代的苯基、苯氧基或苯硫基,

[0242] R^6 和 R^7 彼此独立地优选代表氢, 代表各自任选被卤素或氰基取代的 C_1-C_8- 烷基、 C_3-C_8- 环烷基、 C_1-C_8- 烷氧基、 C_3-C_8- 烯基或 C_1-C_8- 烷氧基 $-C_2-C_8-$ 烷基, 代表各自任选被卤素、 C_1-C_8- 烷基、 C_1-C_8- 卤代烷基或 C_1-C_8- 烷氧基取代的苯基或苯甲基, 或者 R^6 和 R^7 一起代表一个任选被 C_1-C_6- 烷基取代的 C_3-C_6- 亚烷基, 其中任选地一个亚甲基基团被氧或硫代替。

[0243] 在作为优选提及的基团定义中, 卤素代表氟、氯、溴和碘, 特别是氟、氯和溴。

[0244] W 特别优选代表氢、氯、溴、碘、 C_1-C_4- 烷基、 C_2-C_4- 烯基、 C_2-C_4- 炔基、 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,

[0245] X 特别优选代表氯、溴、碘、 C_1-C_4- 烷基、 C_2-C_4- 烯基、 C_2-C_4- 炔基、 C_1-C_4- 烷氧基、 C_1-C_4- 烷氧基 $-C_1-C_3-$ 烷氧基、 C_1-C_2- 卤代烷基、 C_1-C_2- 卤代烷氧基或氰基,

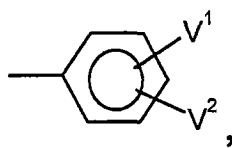
[0246] Y 特别优选在 4- 位上代表氢、氟、氯、溴、碘、甲氧基、乙氧基、氰基、三氟甲基、二氟甲氧基或三氟甲氧基,

[0247] Z 特别优选代表氢,

[0248] W 还特别优选代表氢、氯、溴或 C_1-C_4- 烷基,

[0249] X 还特别优选代表氯、溴、 C_1-C_4- 烷基、 C_1-C_4- 烷氧基、 C_1-C_2- 卤代烷基、 C_1-C_2- 卤代烷氧基或氰基,

[0250] Y 还特别优选在 4- 位上代表 C_2-C_4 - 烯基、 C_2-C_4 - 炔基, 或者代表基团
[0251]



[0252] Z 还特别优选代表氢,

[0253] V^1 还特别优选代表氟、氯、 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,

[0254] V^2 还特别优选代表氢、氟、氯、 C_1-C_4 - 烷基、 C_1-C_4 - 烷氧基或 C_1-C_2 - 卤代烷基,

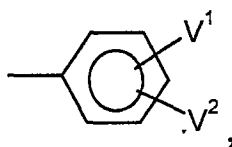
[0255] V^1 和 V^2 一起还特别优选代表 $-O-CH_2-O-$ 和 $-O-CF_2-O-$ 。

[0256] W 同样特别优选代表氢、氯、溴或 C_1-C_4 - 烷基,

[0257] X 同样特别优选代表氯、溴、 C_1-C_4 - 烷基或 C_1-C_2 - 卤代烷基,

[0258] Y 同样特别优选在 5- 位上代表 C_2-C_4 - 烯基、 C_2-C_4 - 炔基, 代表 基团

[0259]



[0260] Z 同样特别优选在 4- 位上代表氢、 C_1-C_4 - 烷基或氯,

[0261] V^1 同样特别优选代表氟、氯、 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,

[0262] V^2 同样特别优选代表氢、氟、氯、 C_1-C_4 - 烷基、 C_1-C_4 - 烷氧基或 C_1-C_2 - 卤代烷基,

[0263] V^1 和 V^2 一起同样特别优选代表 $-O-CH_2-O-$ 或 $-O-CF_2-O-$ 。

[0264] W 另外特别优选代表氢、 C_1-C_4 - 烷基、 C_2-C_4 - 烯基、 C_2-C_4 - 炔基、 C_1-C_4 - 烷氧基、氯、溴、碘或三氟甲基,

[0265] X 另外特别优选代表氯、溴、碘、 C_1-C_4 - 烷基、 C_2-C_4 - 烯基、 C_2-C_4 - 炔基、 C_1-C_4 - 烷氧基、 C_1-C_4 - 烷氧基 - C_1-C_3 - 烷氧基、 C_1-C_2 - 卤代烷基、 C_1-C_2 - 卤代烷氧基或氰基,

[0266] Y 另外特别优选在 4- 位上代表 C_1-C_4 - 烷基,

[0267] Z 另外特别优选代表氢。

[0268] W 此外特别优选代表氢、氯、溴、碘、 C_1-C_4 - 烷基或 C_1-C_4 - 烷氧基,

[0269] X 此外特别优选代表氯、溴、碘、 C_1-C_4 - 烷基、 C_1-C_4 - 烷氧基、 C_1-C_2 - 卤代烷基、 C_1-C_2 - 卤代烷氧基或氰基,

[0270] Y 此外特别优选在 4- 位上代表氢、氯、溴、 C_1-C_4 - 烷基、 C_1-C_2 - 卤代烷基或 C_1-C_2 - 卤代烷氧基,

[0271] Z 此外特别优选在 3- 位或 5- 位上代表氟、氯、溴、碘、 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。

[0272] A 特别优选代表一个任选被 C_1-C_2 - 烷基取代的 C_1-C_3 - 烷二基基团, 或者代表其中任选地一个亚甲基基团被氧代替的 C_5-C_6 - 环烷基。

[0273] B 特别优选代表氢或者各自任选被氟或氯单取代至三取代的 C_1-C_6 - 烷基、 C_2-C_6 - 烯基、 C_1-C_4 - 烷氧基、 C_1-C_4 - 烷氧基 - C_1-C_3 - 烷氧基、 C_1-C_4 - 烷氧基 - 双 - C_1-C_3 - 烷氧基

基,代表任选被氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_2 -卤代烷基、 C_1-C_2 -卤代烷氧基、氰基或硝基单取代至三取代的苯基,代表各自任选被氟、氯、溴、甲基、乙基或三氟甲基单取代或二取代的吡啶基、嘧啶基、噻唑基或噻吩基;或者代表任选被氟、氯、甲基、甲氧基或三氟甲基单取代或二取代的 C_3-C_6 -环烷基,其中任选地一个或两个不直接相邻的亚甲基基团被氧代替,或者 A 特别优选代表一个键且 B 代表氢。

[0274] D 特别优选代表 NH 或氧。

[0275] Q^1 特别优选代表氢,代表任选被氟单取代至三取代的 C_1-C_4 -烷基,

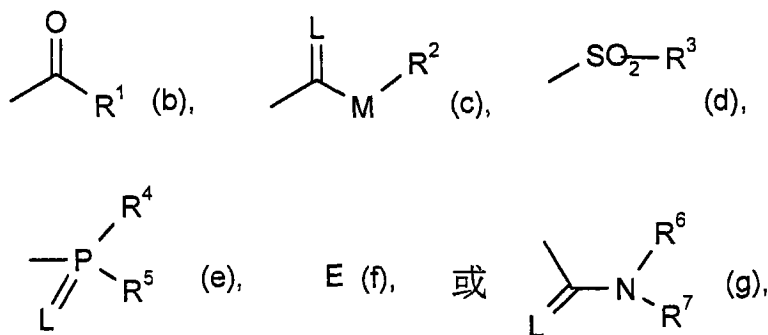
[0276] Q^2 特别优选代表氢或 C_1-C_4 -烷基。

[0277] Q^1 和 Q^2 它们所连接的碳原子一起特别优选代表一个任选被氟、甲基、甲氧基或三氟甲基单取代、且其中一个亚甲基基团可被氧代替的 C_3-C_6 -环,或者

[0278] Q^1 和 Q^2 与它们所连接的多个碳原子一起特别优选代表一个任选被氟、甲基、甲氧基或三氟甲基单取代、且其中一个亚甲基基团可被氧代替的 C_3-C_6 -环。

[0279] G 特别优选代表氢 (a) 或代表以下基团之一,

[0280]



[0281] 其中

[0282] E 代表金属离子或铵离子,

[0283] L 代表氧或硫,并且

[0284] M 代表氧或硫。

[0285] R^1 特别优选代表各自任选被氟或氯单取代至三取代的 C_1-C_{16} -烷基、 C_2-C_{16} -烯基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_6 -烷硫基、 C_1-C_4 -烷基或多 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷基,或者代表任选被氟、氯、 C_1-C_5 -烷基或 C_1-C_5 -烷氧基单取代至二取代、且其中任选地一个或两个不直接相邻的亚甲基基团被氧和 / 或硫代替的 C_3-C_7 -环烷基,

[0286] 特别优选代表任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_3 -卤代烷基、 C_1-C_3 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基或 C_1-C_4 -烷基磺酰基单取代至三取代的苯基,

[0287] 特别优选代表任选被氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_3 -卤代烷基或 C_1-C_3 -卤代烷氧基单取代至二取代的苯基、 C_1-C_4 -烷基,

[0288] 特别优选代表各自任选被氟、氯、溴或 C_1-C_4 -烷基单取代至二取代的吡啶基、噻唑基、吡啶基、嘧啶基、呋喃基或噻吩基,特别优选代表任选被氟、氯、溴或 C_1-C_4 -烷基单取代至二取代的苯氧基、 C_1-C_5 -烷基,或者

[0289] 特别优选代表各自任选被氟、氯、溴、氨基或 C_1-C_4 -烷基单取代至二取代的吡啶基氧基、 C_1-C_5 -烷基、嘧啶基氧基、 C_1-C_5 -烷基或噻唑基氧基、 C_1-C_5 -烷基,

[0290] R^2 特别优选代表各自任选被氟或氯单取代至三取代的 C_1-C_{16} -烷基、 C_2-C_{16} -烯

基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_2-C_6 -烷基或多- C_1-C_6 -烷氧基- C_2-C_6 -烷基，

[0291] 特别优选代表任选被氟、氯、 C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_4 -烷氧基单取代至二取代的 C_3-C_7 -环烷基，或者

[0292] 特别优选代表各自任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_3 -烷氧基、 C_1-C_3 -卤代烷基或 C_1-C_3 -卤代烷氧基单取代至三取代的苯基或苯甲基，

[0293] R^3 特别优选代表任选被氟或氯单取代至三取代的 C_1-C_6 -烷基，或者代表各自任选被氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_2 -代烷氧基、 C_1-C_2 -卤代烷基、氰基或硝基单取代至二取代的苯基或苯甲基，

[0294] R^4 和 R^5 彼此独立地特别优选代表各自任选被氟或氯单取代至三取代的 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷基氨基、二- $(C_1-C_6$ -烷基)氨基、 C_1-C_6 -烷硫基或 C_3-C_4 -烯硫基，或者代表各自任选被氟、氯、溴、硝基、氰基、 C_1-C_3 -烷氧基、 C_1-C_3 -卤代烷氧基、 C_1-C_3 -烷硫基、 C_1-C_3 -卤代烷硫基、 C_1-C_3 -烷基或 C_1-C_3 -卤代烷基单取代至二取代的苯基、苯氧基或苯硫基，

[0295] R^6 和 R^7 彼此独立地特别优选代表氢，代表各自任选被氟或氯单取代至三取代的 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_3-C_6 -烯基或 C_1-C_6 -烷氧基- C_2-C_6 -烷基，代表各自任选被氟、氯、溴、 C_1-C_5 -卤代烷基、 C_1-C_5 -烷基或 C_1-C_5 -烷氧基单取代至三取代的苯基或苯甲基，或者 R^6 和 R^7 一起代表一个任选被 C_1-C_4 -烷基取代的 C_3-C_6 -亚烷基，其中任选地一个亚甲基基团被氧或硫代替。

[0296] 在作为特别优选提及的基团定义中，卤素代表氟、氯和溴，特别是氟和氯。

[0297] W 极特别优选代表氢、氯、溴、碘、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基或三氟甲基，

[0298] X 极特别优选代表氯、溴、碘、甲基、乙基、丙基、甲氧基、乙氧基、丙氧基、甲氧基乙氧基、乙氧基乙氧基、三氟甲基、二氟甲氧基、三氟甲氧基或氰基，

[0299] Y 在 4- 位上极特别优选代表氢、氯、溴、碘、三氟甲基或三氟甲氧基，

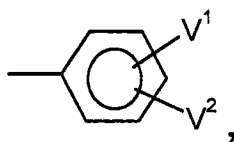
[0300] Z 极特别优选代表氢。

[0301] W 还极特别优选代表氢、氯、溴、甲基或乙基，

[0302] X 还极特别优选代表氯、溴、甲基、乙基、丙基、甲氧基、三氟甲基、二氟甲氧基或氰基，

[0303] Y 还极特别优选在 4- 位代表乙烯基、乙炔基、丙炔基，或者代表基团

[0304]



[0305] Z 还极特别优选代表氢，

[0306] V¹ 还极特别优选代表氟、氯、甲基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基，

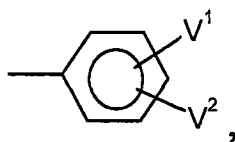
[0307] V² 还极特别优选代表氢、氟、氯、甲基、甲氧基或三氟甲基。

[0308] W 同样极特别优选代表氢、氯或甲基，

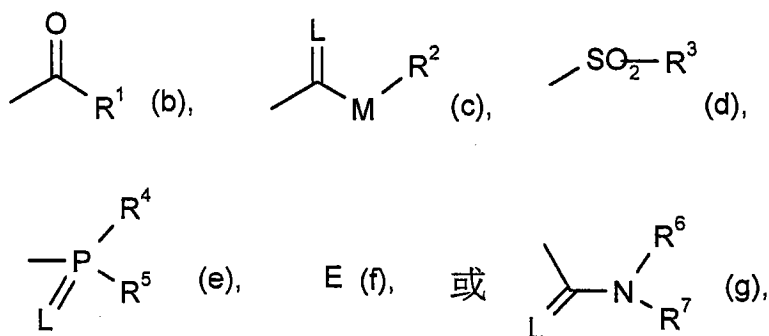
[0309] X 同样极特别优选代表氯、甲基或三氟甲基，

[0310] Y 同样极特别优选在 5- 位代表乙烯基、乙炔基、丙炔基，或者代表基团

[0311]



- [0312] Z 同样极特别优选在 4- 位代表氢或甲基，
- [0313] V^1 同样极特别优选代表氟、氯、甲基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基，
- [0314] V^2 同样极特别优选代表氢、氟、氯、甲基、甲氧基或三氟甲基。
- [0315] W 另外极特别优选代表氢、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、氯、溴或碘，
- [0316] X 另外极特别优选代表氯、溴、碘、甲基、乙基、丙基、甲氧基、乙氧基、丙氧基、甲氧基-乙氧基、乙氧基-乙氧基、三氟甲基、二氟甲氧基、三氟甲氧基或氰基，
- [0317] Y 另外极特别优选在 4- 位上代表甲基或乙基，
- [0318] Z 另外极特别优选代表氢。
- [0319] W 此外极特别优选代表氢、氯、溴、碘、甲基或乙基，
- [0320] X 此外极特别优选代表氯、溴、碘、甲基、乙基、甲氧基、三氟甲基、二氟甲氧基或三氟甲氧基，
- [0321] Y 此外极特别优选在 4- 位上代表氢、氯、溴、碘、甲基或乙基，
- [0322] Z 此外极特别优选在 3- 或 5- 位上代表氟、氯、溴、碘、甲基、乙基、三氟甲基或三氟甲氧基。
- [0323] A 极特别优选代表 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CHCH}_3-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 。
- [0324] B 极特别优选代表氢、甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、 C_2-C_4 - 烯基、甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、丁氧基、异丁氧基、甲氧基-乙氧基、乙氧基-乙氧基，代表任选被氟、氯、溴、甲基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或硝基单取代或二取代的苯基，代表环丙基，代表其中任选地一个亚甲基基团被氧代替的环戊基或环己基，
- [0325] 或者 A 极特别优选代表一个键且 B 代表氢。
- [0326] D 极特别优选代表 NH 或氧。
- [0327] Q^1 极特别优选代表氢、甲基或乙基。
- [0328] Q^2 极特别优选代表氢、甲基或乙基。
- [0329] Q^1 和 Q^2 与它们连接的碳原子一起极特别优选代表环丙基、环戊基或环己基，或者
- [0330] Q^1 和 Q^2 与它们连接的多个碳原子一起极特别优选代表一个任选被氧间隔的 C_5-C_6 环。
- [0331] G 极特别优选代表氢 (a)，或者代表以下基团之一，
- [0332]



[0333] 其中

[0334] E 代表金属离子或铵离子,

[0335] L 代表氧或硫,且

[0336] M 代表氧或硫,

[0337] R^1 极特别优选代表各自任选被氟或氯单取代至三取代的 C_1-C_{10} -烷基、 C_2-C_{10} -烯基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_4 -烷硫基- C_1-C_2 -烷基,或者代表任选被氟、氯、甲基、乙基或甲氧基单取代的 C_3-C_6 -环烷基,

[0338] 极特别优选代表任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、三氟甲基或三氟甲氧基单取代至二取代的苯基,

[0339] 极特别优选代表各自任选被氯、溴或甲基单取代的呋喃基、噻吩基或吡啶基,

[0340] R^2 极特别优选代表各自任选被氟或氯单取代至三取代的 C_1-C_{10} -烷基、 C_2-C_{10} -烯基或 C_1-C_4 -烷氧基- C_2-C_4 -烷基,

[0341] 极特别优选代表环戊基或环己基,

[0342] 或者极特别优选代表各自任选被氟、氯、氰基、硝基、甲基、乙基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基单取代至二取代的苯基或苯甲基,

[0343] R^3 极特别优选代表各自任选被氟或氯单取代至三取代的甲基、乙基、丙基或异丙基,或者代表任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、异丙基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、异丙氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或硝基单取代的苯基,

[0344] R^4 和 R^5 彼此独立地极特别优选代表 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -烷硫基,或者代表各自任选被氟、氯、溴、硝基、氰基、甲基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基单取代的苯基、苯氧基或苯硫基,

[0345] R^6 和 R^7 彼此独立地极特别优选代表氢,代表 C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_3-C_4 -烯基或 C_1-C_4 -烷氧基- C_2-C_4 -烷基,代表任选被氟、氯、溴、甲基、甲氧基或三氟甲基单取代至二取代的苯基,或者 R^6 和 R^7 一起代表一个其中任选地一个亚甲基基团被氧或硫代替的 C_5-C_6 -亚烷基。

[0346] W 尤其优选代表甲基、乙基或甲氧基,

[0347] X 尤其优选代表氯、甲基、乙基或甲氧基,

[0348] Y 尤其优选在 4- 位上代表氯或溴,

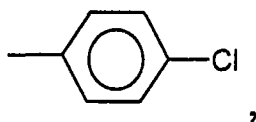
[0349] Z 尤其优选代表氢。

[0350] W 同样尤其优选代表氢,

[0351] X 同样尤其优选代表甲基,

[0352] Y 同样尤其优选在 5- 位上代表基团

[0353]



[0354] Z 尤其优选在 4- 位上代表氢。

[0355] W 另外尤其优选代表甲基或乙基,

[0356] X 另外尤其优选代表氯、溴或甲基,

[0357] Y 另外尤其优选在 4- 位上代表甲基,

[0358] Z 另外尤其优选代表氢。

[0359] A 尤其优选代表 $-\text{CH}_2-$ 或 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$,

[0360] B 尤其优选代表氢、甲基、乙基、丙基、甲氧基或环丙基, 或者 A 尤其优选代表一个键且 B 代表氢。

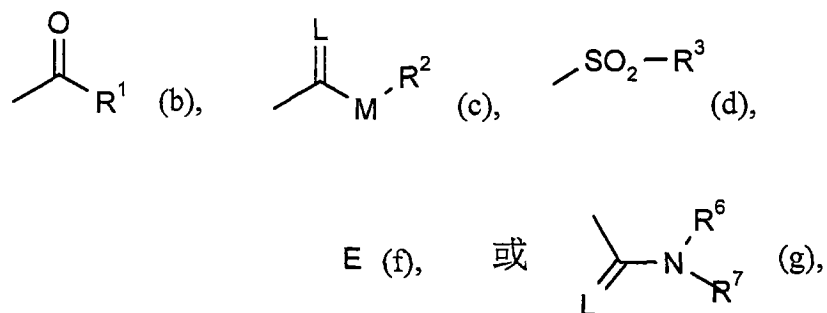
[0361] D 尤其优选代表 NH 。

[0362] Q^1 尤其优选代表氢。

[0363] Q^2 尤其优选代表氢。

[0364] G 尤其优选代表氢 (a), 或者代表以下基团之一,

[0365]



[0366] 最优选的是氢、基团 (b) 和 (c)

[0367] 其中

[0368] E 代表金属离子,

[0369] L 代表氧, 且

[0370] M 代表氧,

[0371] R^1 尤其优选代表 C_1-C_{10} -烷基,

[0372] 代表任选被氯单取代的苯基,

[0373] R^2 尤其优选代表 C_1-C_{10} -烷基或 C_2-C_{10} -烯基,

[0374] R^3 尤其优选代表甲基,

[0375] R^6 和 R^7 一起尤其优选代表一个其中任选地一个亚甲基基团被氧代替的 C_5-C_6 -亚烷基。

[0376] 上文列出的宽泛的或优选的基团定义或说明可按需要互相组合, 即包括各个范围和优选范围之间的组合。它们适用于终产物, 也相应地适用于前体和中间体。

[0377] 本发明优选的是这样的式 (I) 化合物, 它们含有以上列出的优选 (优选的) 含义的组合。

[0378] 本发明特别优选的是这样的式 (I) 化合物, 它们含有以上列出的特别优选含义的组合。

[0379] 本发明极特别优选的是这样的式 (I) 化合物, 它们含有以上列出的极特别优选含义的组合。

[0380] 本发明尤其优选的是这样的式 (I) 化合物, 它们含有以上列出的尤其优选含义的组合。

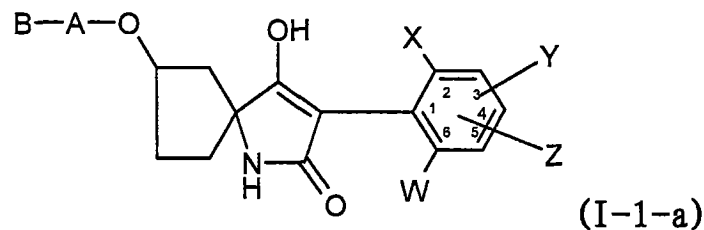
[0381] 只要可能, 饱和或不饱和烃基如烷基、烷二基或烯基——包括与杂原子结合如烷氧基——可各自为直链的或支链的。

[0382] 除非另有说明,任选取代的基团可以是单取代或多取代的,其中在多取代的情况下,取代基可以相同或不同。

[0383] 除在制备实施例中提及的化合物外,还可特别地提及以下式 (I-1-a) 化合物:

[0384] 表 1

[0385]



[0386]

A	B	X	W	Y	Z
CH ₂	H	CH ₃	H	H	H
CH ₂	H	Br	H	H	H
CH ₂	H	Cl	H	H	H
CH ₂	H	CF ₃	H	H	H
CH ₂	H	OCH ₃	H	H	H
CH ₂	H	OC ₂ H ₅	H	H	H
CH ₂	H	Br	H	4-Cl	H
CH ₂	H	Cl	H	4-Br	H
CH ₂	H	Cl	H	4-Cl	H
CH ₂	H	Cl	H	4-CH ₃	H
CH ₂	H	CH ₃	H	4-Cl	H
CH ₂	H	CH ₃	H	4-CH ₃	H
CH ₂	H	Cl	Cl	H	H
CH ₂	H	Cl	OCH ₃	H	H
CH ₂	H	Cl	CH ₃	H	H
CH ₂	H	Cl	OC ₂ H ₅	H	H
CH ₂	H	OCH ₃	OCH ₃	H	H
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	H	H
CH ₂	H	Br	CH ₃	4-Br	H
CH ₂	H	Cl	Cl	4-CH ₃	H

[0387]

A	B	X	W	Y	Z
CH ₂	H	CH ₃	Br	4-CH ₃	H
CH ₂	H	CH ₃	Cl	4-CH ₃	H
CH ₂	H	OCH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H
CH ₂	H	OC ₂ H ₅	CH ₃	4-CH ₃	H
CH ₂	H	OC ₃ H ₇	CH ₃	4-CH ₃	H
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H
CH ₂	H	Br	Br	4-CH ₃	H
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	4-Br	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H
CH ₂	H	OCH ₃	C ₂ H ₅	4-CH ₃	H
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃	H
CH ₂	H	Br	Cl	4-CH ₃	H
CH ₂	H	Br	CH ₃	4-Cl	H
CH ₂	H	Cl	CH ₃	4-Br	H

CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₃	4-CH ₃	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₃	4-C ₂ H ₅	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-CH ₃	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-C ₂ H ₅	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₃	4-Cl	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₃	4-Br	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Br	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	Cl	4-CH ₃	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	Cl	4-Cl	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	Br	4-Br	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	Cl	4-Br	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	Br	4-Cl	H
CH ₂	H	OCH ₃	CH ₃	4-Cl	H
CH ₂	H	OCH ₃	C ₂ H ₅	4-Cl	H
CH ₂	H	OC ₂ H ₅	CH ₃	4-Cl	H
CH ₂	H	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl	H

[0388]

A	B	X	W	Y	Z
CH ₂	H	Cl	OCH ₃	4-CH ₃	H
CH ₂	H	Cl	OC ₂ H ₅	4-CH ₃	H
CH ₂	H	Cl	Cl	4-Cl	H
CH ₂	H	Cl	H	4-Cl	5-Cl
CH ₂	H	CH ₃	H	4-CH ₃	5-CH ₃
CH ₂	H	CH ₃	H	4-Cl	5-CH ₃
CH ₂	H	Br	H	4-Cl	5-CH ₃
CH ₂	H	Br	H	4-CH ₃	5-CH ₃
CH ₂	H	Cl	H	4-Br	5-CH ₃
CH ₂	H	Cl	H	4-Cl	5-CH ₃
CH ₂	H	CH ₃	H	4-Br	5-CH ₃
CH ₂	H	Cl	H	4-CH ₃	5-Cl
CH ₂	H	CH ₃	H	H	5-CH ₃
CH ₂	H	Cl	H	H	5-CH ₃
CH ₂	H	Br	H	H	5-CH ₃
CH ₂	H	CH ₃	H	H	5-Cl
CH ₂	H	CH ₃	H	H	5-Br
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	5-Cl
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	5-Br
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	H	3-Cl
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	H	3-Br
CH ₂	H	Cl	Cl	H	3-Br
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₃	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H
CH ₂	H	Cl	CH ₃	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H
CH ₂	H	Cl	C ₂ H ₅	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H
CH ₂	H	CH ₃	H	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H
CH ₂	H	CH ₃	H	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	4-CH ₃

CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	4-CH ₃
CH ₂	H	Cl	H	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H
CH ₂	H	O-(CH ₂) ₂ -OCH ₃	CH ₃	4-Cl	H

[0389]

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

[0390] 表 2: A、W、X、Y 和 Z 如表 1 中所述

[0391] B = CH₃

[0392] 表 3: A、W、X、Y 和 Z 如表 1 中所述

[0393] B = C₂H₅

[0394] 表 4: A、W、X、Y 和 Z 如表 1 中所述

[0395] B = C₃H₇

[0396] 表 5: A、W、X、Y 和 Z 如表 1 中所述

[0397] B = i-C₃H₇

[0398] 表 6: A、W、X、Y 和 Z 如表 1 中所述

[0399] B = 

[0400] 表 7: A、W、X、Y 和 Z 如表 1 中所述

[0401] B = 

[0402] 表 8: A、W、X、Y 和 Z 如表 1 中所述

[0403] A = -CH₂-CH₂-; B = OCH₃

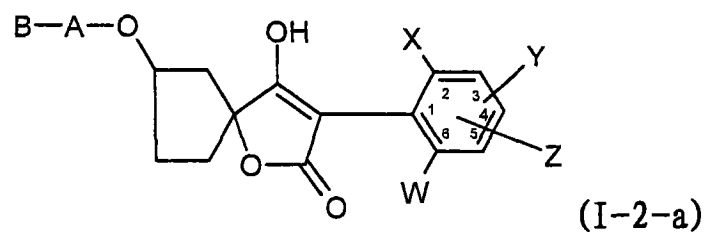
[0404] 表 9: A、W、X、Y 和 Z 如表 1 中所述

[0405] $A = -CH_2-CH_2-$; $B = OC_2H_5$

[0406] 除在制备实施例中提及的化合物外,还可特别提及以下式 (I-2-a) 化合物:

[0407] 表 10

[0408]



[0409]

A	B	X	W	Y	Z
CH ₂	H	CH ₃	H	H	H
CH ₂	H	Br	H	H	H
CH ₂	H	C1	H	H	H
CH ₂	H	CF ₃	H	H	H
CH ₂	H	OCH ₃	H	H	H
CH ₂	H	Br	H	4-C1	H
CH ₂	H	C1	H	4-Br	H
CH ₂	H	C1	H	4-C1	H
CH ₂	H	C1	H	4-CH ₃	H
CH ₂	H	CH ₃	H	4-C1	H
CH ₂	H	CH ₃	H	4-CH ₃	H
CH ₂	H	C1	C1	H	H
CH ₂	H	C1	OCH ₃	H	H
CH ₂	H	C1	CH ₃	H	H

[0410]

A	B	X	W	Y	Z
CH ₂	H	Cl	OC ₂ H ₅	H	H
CH ₂	H	OCH ₃	OCH ₃	H	H
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	H	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H
CH ₂	H	Br	CH ₃	4-Br	H
CH ₂	H	Cl	Cl	4-CH ₃	H
CH ₂	H	CH ₃	Br	4-CH ₃	H
CH ₂	H	CH ₃	Cl	4-CH ₃	H
CH ₂	H	OCH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H
CH ₂	H	OCH ₃	C ₂ H ₅	4-CH ₃	H
CH ₂	H	OC ₂ H ₅	CH ₃	4-CH ₃	H
CH ₂	H	OC ₃ H ₇	CH ₃	4-CH ₃	H
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H
CH ₂	H	Br	Br	4-CH ₃	H
CH ₂	H	Cl	Cl	4-CH ₃	H
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	4-Br	H
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃	H
CH ₂	H	Br	Cl	4-CH ₃	H
CH ₂	H	Br	CH ₃	4-Cl	H
CH ₂	H	Cl	CH ₃	4-Br	H
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₃	4-CH ₃	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-CH ₃	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₃	4-C ₂ H ₅	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-C ₂ H ₅	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₃	4-Cl	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₃	4-Br	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Br	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	Cl	4-CH ₃	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	Cl	4-Cl	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	Br	4-Br	H

[0411]

A	B	X	W	Y	Z
CH ₂	H	C ₂ H ₅	Cl	4-Br	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	Br	4-Cl	H
CH ₂	H	OCH ₃	CH ₃	4-Cl	H
CH ₂	H	OCH ₃	C ₂ H ₅	4-Cl	H
CH ₂	H	OC ₂ H ₅	CH ₃	4-Cl	H
CH ₂	H	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl	H
CH ₂	H	Cl	OCH ₃	4-CH ₃	H
CH ₂	H	Cl	OC ₂ H ₅	4-CH ₃	H
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H
CH ₂	H	Cl	H	4-Cl	5-Cl
CH ₂	H	CH ₃	H	4-CH ₃	5-CH ₃
CH ₂	H	CH ₃	H	4-Cl	5-CH ₃
CH ₂	H	Br	H	4-Cl	5-CH ₃
CH ₂	H	Br	H	4-CH ₃	5-CH ₃
CH ₂	H	Cl	H	4-Br	5-CH ₃
CH ₂	H	Cl	H	4-Cl	5-CH ₃
CH ₂	H	CH ₃	H	4-Br	5-CH ₃
CH ₂	H	Cl	H	4-CH ₃	5-Cl
CH ₂	H	CH ₃	H	H	5-CH ₃
CH ₂	H	Cl	H	H	5-CH ₃
CH ₂	H	Br	H	H	5-CH ₃
CH ₂	H	CH ₃	H	H	5-Cl
CH ₂	H	CH ₃	H	H	5-Br
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	5-Cl
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	5-Br
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	H	3-Cl
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	H	3-Br
CH ₂	H	Cl	Cl	H	3-Br
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₃	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H
CH ₂	H	Cl	CH ₃	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H
CH ₂	H	Cl	C ₂ H ₅	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H

[0412]

A	B	X	W	Y	Z
CH ₂	H	CH ₃	H	5-(4-C1-C ₆ H ₄)	H
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	5-(4-C1-C ₆ H ₄)	H
CH ₂	H	CH ₃	H	5-(4-C1-C ₆ H ₄)	4-CH ₃
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	5-(4-C1-C ₆ H ₄)	4-CH ₃
CH ₂	H	C1	H	5-(4-C1-C ₆ H ₄)	H
CH ₂	H	I	H	H	H
CH ₂	H	I	H	4-CH ₃	H
CH ₂	H	I	CH ₃	H	H
CH ₂	H	I	C ₂ H ₅	H	H
CH ₂	H	CH ₃	H	H	5-I
CH ₂	H	CH ₃	H	4-CH ₃	5-I
CH ₂	H	I	CH ₃	4-CH ₃	H
CH ₂	H	I	C ₂ H ₅	4-CH ₃	H
CH ₂	H	I	CH ₃	4-C1	H
CH ₂	H	I	C ₂ H ₅	4-C1	H
CH ₂	H	I	C1	4-CH ₃	H
CH ₂	H	I	H	4-CH ₃	5-CH ₃
CH ₂	H	CH ₃	H	4-I	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	H	4-I	H
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	4-I	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₃	4-I	H
CH ₂	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-I	H
CH ₂	H	C1	CH ₃	4-I	H
CH ₂	H	C1	C ₂ H ₅	4-I	H
CH ₂	H	CH ₃	H	4-I	5-CH ₃
CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	H	3-I
CH ₂	H	I	H	H	5-CH ₃

[0413] 表 11: A、W、X、Y 和 Z 如表 10 中所述

[0414] B = CH₃

[0415] 表 12: A、W、X、Y 和 Z 如表 10 中所述

[0416] B = C₂H₅

[0417] 表 13: A、W、X、Y 和 Z 如表 10 中所述

[0418] B = C₃H₇

[0419] 表 14: A、W、X、Y 和 Z 如表 10 中所述

[0420] B = i-C₃H₇

[0421] 表 15: A、W、X、Y 和 Z 如表 10 中所述

[0422] $B =$ 

[0423] 表 16: A、W、X、Y 和 Z 如表 10 中所述

[0424] $B =$ 

[0425] 表 17: W、X、Y 和 Z 如表 10 中所述

[0426] $A = -CH_2-CH_2-; B = OCH_3$

[0427] 表 18: W、X、Y 和 Z 如表 10 中所述

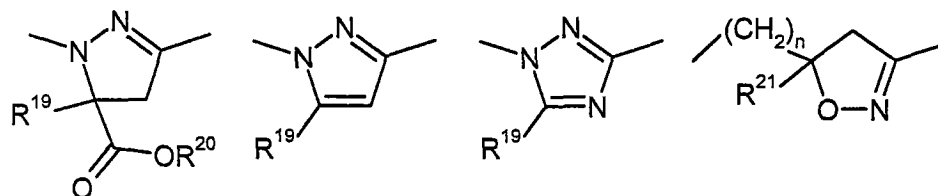
[0428] $A = -CH_2-CH_2-; B = OC_2H_5$

[0429] 上文中列出的与式 (IIa)、(IIb)、(IIc)、(IId) 和 (IIe) 的改进作物植物相容性化合物 (“除草剂安全剂”) 相关的基团的优选定义如下。

[0430] m 优选代表数字 0、1、2、3 或 4。

[0431] A^1 优选代表以下所示二价杂环基团之一

[0432]



[0433] n 优选代表数字 0、1、2、3 或 4。

[0434] A^2 优选代表各自任选被甲基、乙基、甲氧基羰基、乙氧基羰基或烷氧基羰基取代的亚甲基或亚乙基。

[0435] R^{14} 优选代表羟基、巯基、氨基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基或叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、正丙硫基或异丙硫基、正丁硫基、异丁硫基、仲丁硫基或叔丁硫基、甲基氨基、乙基氨基、正丙基氨基或异丙基氨基、正丁基氨基、异丁基氨基、仲丁基氨基或叔丁基氨基、二甲基氨基或二乙基氨基。

[0436] R^{15} 优选代表羟基、巯基、氨基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基或叔丁氧基、1-甲基己氧基、烯丙氧基、1-烯丙氧基甲基乙氧基、甲硫基、乙硫基、正丙硫基或异丙硫基、正丁硫基、异丁硫基、仲丁硫基或叔丁硫基、甲基氨基、乙基氨基、正丙基氨基或异丙基氨基、正丁基氨基、异丁基氨基、仲丁基氨基或叔丁基氨基、二甲基氨基或二乙基氨基。

[0437] R^{16} 优选代表各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基。

[0438] R^{17} 优选代表氢、各自任选被氟和 / 或氯取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基乙基、二氧戊环基甲基、呋喃基、呋喃基甲基、噻吩基、噻唑基、哌啶基, 或者任选被氟、氯、甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基取代的苯基。

[0439] R^{18} 优选代表氢, 各自任选被氟和 / 或氯取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基乙基、二氧戊环基甲基、呋喃基、呋喃基甲基、噻吩基、噻唑基、哌啶

基,或者任选被氟、氯、甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基取代的苯基,或者与 R^{17} 一起代表任选被甲基、乙基、呋喃基、苯基、稠合苯环取代或者被两个取代基取代的基团 $-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 和 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 之一,所述两个取代基与它们连接的 C 原子一起形成一个五元或六元碳环。

[0440] R^{19} 优选代表氢、氰基、氟、氯、溴,或者代表各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基或苯基。

[0441] R^{20} 优选代表氢,各自任选被羟基、氰基、氟、氯、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基。

[0442] R^{21} 优选代表氢、氰基、氟、氯、溴,或者代表各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基或苯基。

[0443] X^1 优选代表硝基、氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、二氟甲基、二氯甲基、三氟甲基、三氯甲基、一氯二氟代甲基、一氟二氯代甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基。

[0444] X^2 优选代表氢、硝基、氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、二氟甲基、二氯甲基、三氟甲基、三氯甲基、一氯二氟代甲基、一氟二氯代甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基。

[0445] X^3 优选代表氢、硝基、氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、二氟甲基、二氯甲基、三氟甲基、三氯甲基、一氯二氟代甲基、一氟二氯代甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基。

[0446] t 优选代表数字 0、1、2、3 或 4。

[0447] v 优选代表数字 0、1、2、3 或 4。

[0448] R^{22} 优选代表氢、甲基、乙基、正丙基或异丙基。

[0449] R^{23} 优选代表氢、甲基、乙基、正丙基或异丙基。

[0450] R^{24} 优选代表氢、各自任选被氰基、氟、氯、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基或叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、正丙硫基或异丙硫基、正丁硫基、异丁硫基、仲丁硫基或叔丁硫基、甲基氨基、乙基氨基、正丙基氨基或异丙基氨基、正丁基氨基、异丁基氨基、仲丁基氨基或叔丁基氨基、二甲基氨基或二乙基氨基,或者各自任选地被氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环丙基氧基、环丁基氧基、环戊基氧基、环己基氧基、环丙基硫基、环丁基硫基、环戊基硫基、环己基硫基、环丙基氨基、环丁基氨基、环戊基氨基或环己基氨基。

[0451] R^{25} 优选代表氢,各自任选被氰基、羟基、氟、氯、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基或仲丁基,各自任选被氰基、氟、氯或溴取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基,或者各自任选被氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基。

[0452] R^{26} 优选代表氢,各自任选被氰基、羟基、氟、氯、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基或仲丁基,各自任选被氰基、氟、氯或溴取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基,各自任选被氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙

基或异丙基取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基,或者任选被硝基、氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基取代的苯基,或者与 R^{25} 一起代表各自任选被甲基或乙基取代的丁-1,4-二基(1,3-亚丙基)、戊-1,5-二基、1-氧杂丁-1,4-二基或3-氧杂戊-1,5-二基。

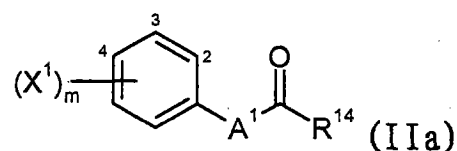
[0453] X^4 优选代表硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、甲酰基、氨基磺酰基、羟基、氨基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基。

[0454] X^5 优选代表硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、甲酰基、氨基磺酰基、羟基、氨基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基。

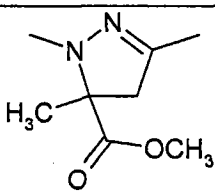
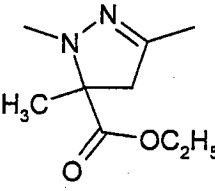
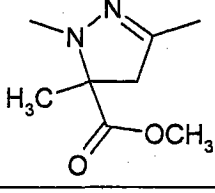
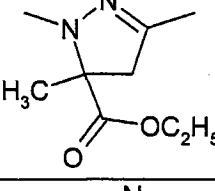
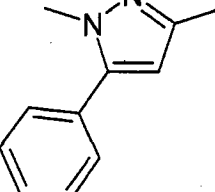
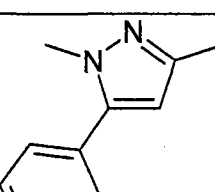
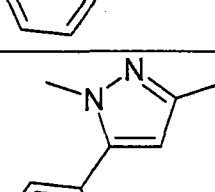
[0455] 极特别优选作为本发明的除草剂安全剂的式 (IIa) 化合物的实例列于下表 19 中。

[0456] 表 19: 式 (IIa) 化合物的实例

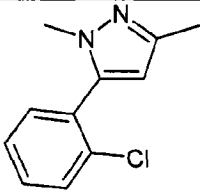
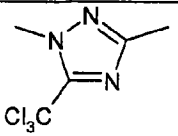
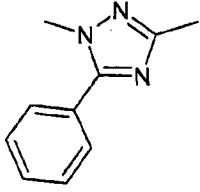
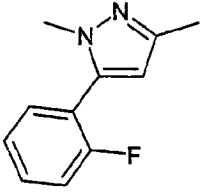
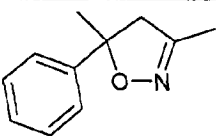
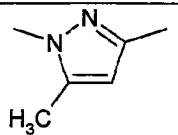
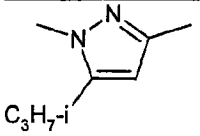
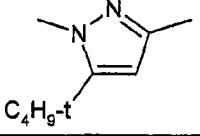
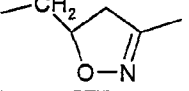
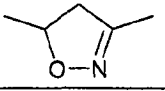
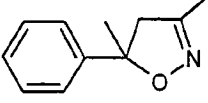
[0457]



[0458]

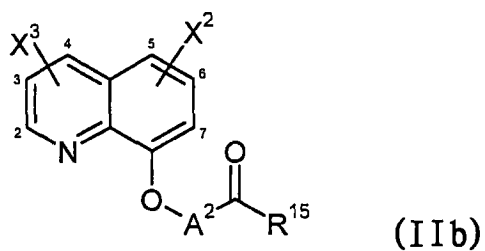
实例 编号	(位置) (X ¹) _n	A ¹	R ¹⁴
IIa-1	(2) C1, (4) C1		OCH ₃
IIa-2	(2) C1, (4) C1		OCH ₃
IIa-3	(2) C1, (4) C1		OC ₂ H ₅
IIa-4	(2) C1, (4) C1		OC ₂ H ₅
IIa-5	(2) C1		OCH ₃
IIa-6	(2) C1, (4) C1		OCH ₃
IIa-7	(2) F		OCH ₃

[0459]

实例 编号	(位置) (X ¹) _a	A ¹	R ¹⁴
IIa-8	(2) F		OCH ₃
IIa-9	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-10	(2) Cl, (4) CF ₃		OCH ₃
IIa-11	(2) Cl		OCH ₃
IIa-12	-		OC ₂ H ₅
IIa-13	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-14	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-15	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-16	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-17	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-18	-		OH

[0460] 极特别优选作为本发明的除草剂安全剂的式 (IIb) 化合物的实例列于下表 20 中。

[0461]



[0462] 表 20 : 式 (IIb) 化合物的实例

[0463]

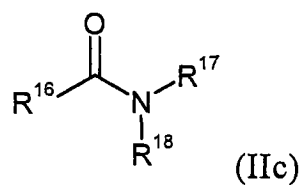
实例 编号	(位置) X^2	(位置) X^3	A^2	R^{15}
IIb-1	(5) C1	—	CH_2	OH
IIb-2	(5) C1	—	CH_2	OCH_3
IIb-3	(5) C1	—	CH_2	OC_2H_5
IIb-4	(5) C1	—	CH_2	OC_3H_7-n
IIb-5	(5) C1	—	CH_2	OC_3H_7-i
IIb-6	(5) C1	—	CH_2	OC_4H_9-n
IIb-7	(5) C1	—	CH_2	$OCH(CH_3)C_5H_{11-n}$
IIb-8	(5) C1	(2) F	CH_2	OH
IIb-9	(5) C1	(2) C1	CH_2	OH
IIb-10	(5) C1	—	CH_2	$OCH_2CH=CH_2$
IIb-11	(5) C1	—	CH_2	OC_4H_9-i

[0464]

实例 编号	(位置) X^2	(位置) X^3	A^2	R^{15}
IIb-12	(5) Cl	—	CH_2	
IIb-13	(5) Cl	—		$OCH_2CH=CH_2$
IIb-14	(5) Cl	—		OC_2H_5
IIb-15	(5) Cl	—		OCH_3

[0465] 极特别优选作为本发明的除草剂安全剂的式 (IIc) 化合物的实例列于下表 21 中。

[0466]

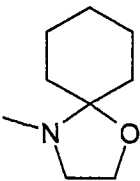
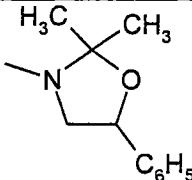
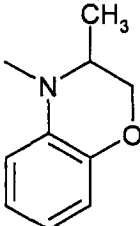
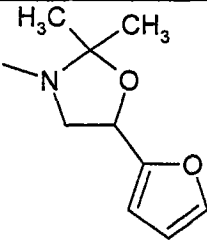


[0467] 表 21: 式 (IIc) 化合物的实例

[0468]

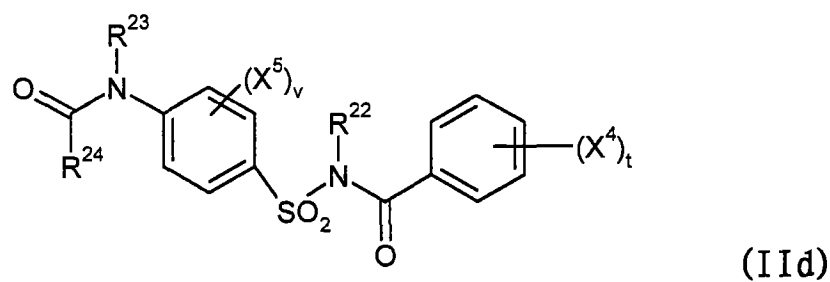
实例 编号	R^{16}	$N(R^{17}, R^{18})$
IIc-1	$CHCl_2$	$N(CH_2CH=CH_2)_2$
IIc-2	$CHCl_2$	
IIc-3	$CHCl_2$	

[0469]

实例 编号	R^{16}	$N(R^{17}, R^{18})$
IIc-4	$CHCl_2$	
IIc-5	$CHCl_2$	
IIc-6	$CHCl_2$	
IIc-7	$CHCl_2$	

[0470] 极特别优选作为本发明的除草剂安全剂的式 (IIId) 化合物的实例列于下表 22 中。

[0471]

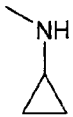


[0472] 表 22: 式 (IIId) 化合物的实例

[0473]

实例 编号	R^{22}	R^{23}	R^{24}	(位置) $(X^4)_t$	(位置) $(X^5)_v$
IIId-1	H	H	CH_3	(2) OCH_3	—
IIId-2	H	H	C_2H_5	(2) OCH_3	—
IIId-3	H	H	C_3H_7-n	(2) OCH_3	—
IIId-4	H	H	C_3H_7-i	(2) OCH_3	—

[0474]

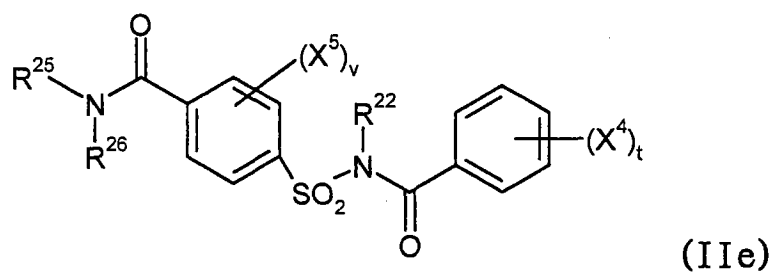
实例 编号	R^{22}	R^{23}	R^{24}	(位置) (X^4) _t	(位置) (X^5) _v
IId-5	H	H		(2) OCH_3	—
IId-6	H	H	CH_3	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-7	H	H	C_2H_5	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-8	H	H	C_3H_7-n	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-9	H	H	C_3H_7-i	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-10	H	H		(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-11	H	H	OCH_3	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-12	H	H	OC_2H_5	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-13	H	H	OC_3H_7-i	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-14	H	H	SCH_3	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-15	H	H	SC_2H_5	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-16	H	H	SC_3H_7-i	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-17	H	H	$NHCH_3$	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-18	H	H	NHC_2H_5	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-19	H	H	NHC_3H_7-i	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-20	H	H		(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-21	H	H	$NHCH_3$	(2) OCH_3	—

[0475]

实例 编号	R^{22}	R^{23}	R^{24}	(位置) (X^4) _t	(位置) (X^5) _v
IId-22	H	H	NHC_3H_7-i	(2) OCH_3	—
IId-23	H	H	$N(CH_3)_2$	(2) OCH_3	—
IId-24	H	H	$N(CH_3)_2$	(3) CH_3 (4) CH_3	—
IId-25	H	H	CH_2-O-CH_3	(2) OCH_3	—

[0476] 极特别优选作为本发明的除草剂安全剂的式 (IIe) 化合物的实例列于下表 23 中。

[0477]



[0478] 表 23: 式 (IIe) 化合物的实例

[0479]

实例 编号	R ²²	R ²⁵	R ²⁶	(位置) (X ⁴) _t	(位置) (X ⁵) _v
Ile-1	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃	—
Ile-2	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃	—
Ile-3	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃	—
Ile-4	H	H	C ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃	—
Ile-5	H	H		(2) OCH ₃	—
Ile-6	H	CH ₃	CH ₃	(2) OCH ₃	—
Ile-7	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	—
Ile-8	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	—
Ile-9	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	—
Ile-10	H	H	C ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	—
Ile-11	H	H		(2) OCH ₃ (5) CH ₃	—

[0480]

实例 编号	R ²²	R ²⁵	R ²⁶	(位置) (X ⁴) _t	(位置) (X ⁵) _v
Ile-12	H	CH ₃	CH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	—

[0481] 最优选作为改进作物植物相容性的化合物[组分(b')]有:解草酯、解草唑、双苯噁唑酸、吡唑解草酯、解草噁唑、解草啉、苄草隆、杀草隆、哌草丹及化合物 Ile-5(cyprosulfamide) 和 Ile-11, 特别强调解草酯和吡唑解草酯, 还有双苯噁唑酸和 cyprosulfamide。

[0482] 用作本发明的安全剂的通式 (IIa) 化合物是已知的, 并且 / 或者可通过本身已知的方法制备 (参见 WO-A-91/07874、WO-A-95/07897)。

[0483] 用作本发明的安全剂的通式 (IIb) 化合物是已知的, 并且 / 或者可通过本身已知的方法制备 (参见 EP-A-191736)。

[0484] 用作本发明的安全剂的通式 (IIc) 化合物是已知的, 并且 / 或者可通过本身已知的方法制备 (参见 DE-A-2218097、DE-A-2350547)。

[0485] 用作本发明的安全剂的通式 (IIId) 化合物是已知的, 并且 / 或者可通过本身已知的方法制备 (参见 DE-A-19621522/US-A-6235680)。

[0486] 用作本发明的安全剂的通式 (IIe) 化合物是已知的, 并且 / 或者可通过本身已知的方法制备 (参见 WO-A-99/66795/US-A-6251827)。

[0487] 各自包括一种式 (I) 活性化合物和上文定义的安全剂之一的本发明的选择性除草结合物的实例列于下表 24 中。

[0488] 表 24: 本发明的结合物的实例

[0489]

式 (I) 活性化合物	安全剂
I-1-a	解草酯
I-1-a	解草唑
I-1-a	双苯噁唑酸
I-1-a	吡唑解草酯
I-1-a	解草噁唑
I-1-a	解草啶
I-1-a	苄草隆
I-1-a	杀草隆
I-1-a	哌草丹

[0490]

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

I-1-d	解草啉
I-1-d	苄草隆
I-1-d	杀草隆
I-1-d	哌草丹
I-1-d	Ile-11
I-1-d	Ile-5

[0491]

式 (I) 活性化合物	安全剂
I-1-e	解草酯
I-1-e	解草唑
I-1-e	双苯噁唑酸
I-1-e	吡唑解草酯
I-1-e	解草噁唑
I-1-e	解草啉
I-1-e	苄草隆
I-1-e	杀草隆
I-1-e	哌草丹
I-1-e	Ile-5
I-1-e	Ile-11
I-1-f	解草酯
I-1-f	解草唑
I-1-f	双苯噁唑酸
I-1-f	吡唑解草酯
I-1-f	解草噁唑
I-1-f	解草啉
I-1-f	苄草隆
I-1-f	杀草隆
I-1-f	哌草丹
I-1-f	Ile-5
I-1-f	Ile-11
I-1-g	解草酯
I-1-g	解草唑
I-1-g	双苯噁唑酸
I-1-g	吡唑解草酯
I-1-g	解草噁唑
I-1-g	解草啉
I-1-g	苄草隆
I-1-g	杀草隆
I-1-g	哌草丹
I-1-g	Ile-5
I-1-g	Ile-11

[0492] 表 25 :本发明的结合物的实例

[0493]

式 (I) 活性化合物	安全剂
I-2-a	解草酯
I-2-a	解草唑
I-2-a	双苯噁唑酸
I-2-a	吡唑解草酯
I-2-a	解草噁唑
I-2-a	解草啉
I-2-a	苄草隆

I-2-a	杀草隆
I-2-a	哌草丹
I-2-a	Ile-11
I-2-a	Ile-5
I-2-b	解草酯
I-2-b	解草唑
I-2-b	双苯噁唑酸
I-2-b	吡唑解草酯
I-2-b	解草噁唑
I-2-b	解草啶
I-2-b	苄草隆
I-2-b	杀草隆
I-2-b	哌草丹
I-2-b	Ile-11
I-2-b	Ile-5
I-2-c	解草酯
I-2-c	解草唑
I-2-c	双苯噁唑酸
I-2-c	吡唑解草酯
I-2-c	解草噁唑
I-2-c	解草啶
I-2-c	苄草隆
I-2-c	杀草隆
I-2-c	哌草丹
I-2-c	Ile-5
I-2-c	Ile-11
I-2-d	解草酯
I-2-d	解草唑

[0494]

式 (I) 活性化合物	安全剂
I-2-d	双苯噁唑酸
I-2-d	吡唑解草酯
I-2-d	解草噁唑
I-2-d	解草啶
I-2-d	苄草隆
I-2-d	杀草隆
I-2-d	哌草丹
I-2-d	Ile-11
I-2-d	Ile-5
I-2-e	解草酯
I-2-e	解草唑
I-2-e	双苯噁唑酸
I-2-e	吡唑解草酯
I-2-e	解草噁唑
I-2-e	解草啶
I-2-e	苄草隆
I-2-e	杀草隆
I-2-e	哌草丹
I-2-e	Ile-5
I-2-e	Ile-11
I-2-f	解草酯
I-2-f	解草唑

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

[0495]

式 (I) 活性化合物	安全剂
I-2-g	解草噁唑
I-2-g	解草啶
I-2-g	苄草隆
I-2-g	杀草隆
I-2-g	哌草丹
I-2-g	IIe-5
I-2-g	IIe-11

[0496] 令人惊讶地,现已发现上文定义的通式 (I) 的取代环状酮基烯醇与上述 (b') 组列出的安全剂 (解毒剂) 的活性化合物结合物,在与有益植物具有非常好的相容性的同时,还具有特别高的除草活性,可在多种作物中用于选择性防治杂草,所述作物特别是谷物 (尤其是小麦),以及大豆、马铃薯、玉米和稻。

[0497] 此处应当认为出人意料的是,众多能对抗除草剂对作物有害作用的已知安全剂或解毒剂中,特别是上述 (b') 组的化合物适用于几乎完全地消除取代环状酮基烯醇对作物的有害作用,而不对除去杂草的除草活性产生较大的不利影响。

[0498] 这里可强调的是特别优选和最优选的组 (b') 结合组分所具有的特别有利的药效,特别是在不伤害谷物植物 (例如小麦、大麦和黑麦)、以及玉米和稻等作物植物方面。

[0499] 文献中已描述了多种活性化合物的作用如何通过加入铵盐而得以增强。但是,所述盐是洗涤剂式的盐 (例如 WO 95/017817) 或具有相对较长的烷基取代基和 / 或芳基取代基的盐,它们具有可渗透作用或能够增加活性化合物溶解度 (例如 EP-A-0 453 086、EP-A 0 664 081、FR-A2 600 494、US 4 844 734、US 5 462 912、US 5 538 937、US-A 03/0224939、US-A 05/0009880、US-A 05/0096386)。另外,现有技术仅描述了针对特定活性化合物和 / 或对应组合物特定应用的作用。在其它情况下,反过来,所述盐是磺酸的盐,其中酸本身对昆虫具有麻痹作用 (US 2 842476)。已通过实例的方式记载了通过例如硫酸铵产生对于除草剂草甘膦 (glyphosate) 和草铵膦 (phosphinothricin) 的作用的增强 (US 6 645 914、EP-A2 0 036 106)。对于杀昆虫剂的相应的作用未被该现有技术公开或暗示。

[0500] 还记载了硫酸铵针对某些活性化合物及应用的作为一种制剂助剂的用途 (WO 92/16108),但文献中其目的是为了制剂稳定而不是为了使作用增强。

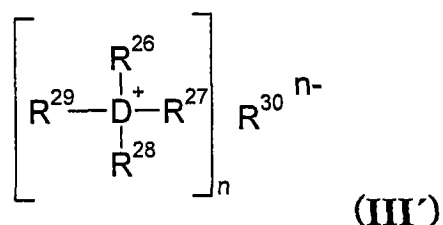
[0501] 现已完全令人惊讶地发现,3' - 烷氧基螺环戊基取代的特特拉姆酸和特窗酸类的杀昆虫剂和 / 或杀螨虫剂和 / 或除草剂的作用可通过向施用溶液中加入铵盐或磷盐,或

者通过这些盐掺入含有 3' - 烷氧基螺环戊基取代化合物的制剂中而显著增强。本发明因此提供铵盐或磷盐用于增强作物保护组合物的作用的用途,所述组合物包括杀昆虫和 / 或杀螨虫的 3' - 烷氧基螺环戊基取代的特特拉姆酸和特窗酸作为其活性化合物特特拉姆酸和特窗酸。本发明同样还提供包括杀昆虫的 3' - 烷氧基螺环戊基取代的特特拉姆酸和特窗酸以及使作用增强的铵盐或磷盐的组合物,所述组合物不仅包括已制剂的活性化合物,还包括即用的组合物(喷洒液)。最后,本发明还提供这些组合物用于防治害虫和 / 或蛛螨(spider mites)和 / 或不想要的植物的用途。这些组合物还可包括上述改进作物植物相容性的化合物。

[0502] 活性化合物可以宽浓度范围用于本发明的组合物中。活性化合物在制剂中的浓度通常为 0.1 重量% -50 重量%。

[0503] 创造性地增强了包含脂肪酸生物合成抑制剂的作物保护组合物的活性的铵盐和磷盐由式(III')定义

[0504]



[0505] 其中

[0506] D 代表氮或磷,

[0507] D 优选代表氮,

[0508] R^{26} 、 R^{27} 、 R^{28} 和 R^{29} 彼此独立地代表氢,或者各自任选取代的 C_1 - C_8 -烷基,或者单不饱和或多不饱和的、任选取代的 C_1 - C_8 -烯烃基(alkylene),所述的取代基可选自卤素、硝基和氰基,

[0509] R^{26} 、 R^{27} 、 R^{28} 和 R^{29} 彼此独立地优选代表氢,或各自任选取代的 C_1 - C_4 -烷基,所述取代基可选自卤素、硝基和氰基,

[0510] R^{26} 、 R^{27} 、 R^{28} 和 R^{29} 彼此独立地特别优选代表氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基,

[0511] R^{26} 、 R^{27} 、 R^{28} 和 R^{29} 极特别优选代表氢,

[0512] n 代表 1、2、3 或 4,

[0513] n 优选代表 1 或 2,

[0514] R^{30} 代表有机或无机阴离子,

[0515] R^{30} 优选代表碳酸氢根、四硼酸根、氟离子、溴离子、碘离子、氯离子、磷酸一氢根、磷酸二氢根、硫酸氢根、酒石酸根、硫酸根、硝酸根、硫代硫酸根、硫氰酸根、甲酸根、乳酸根、乙酸根、丙酸根、丁酸根、戊酸根或草酸根,

[0516] R^{30} 特别优选代表乳酸根、硫酸根、硝酸根、硫代硫酸根、硫氰酸根、草酸根或甲酸根。

[0517] R^{30} 极特别优选代表硫酸根。

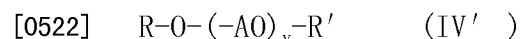
[0518] 式(III')的铵盐和磷盐可以宽的浓度范围使用,以增强含有酮基烯醇的作物保

护组合物的活性。通常,铵盐或磷盐以 0.5 至 80mmol/l、优选 0.75 至 37.5mmol/l、更优选 1.5 至 25mmol/l 的浓度用于即用作物保护组合物中。如果是制剂产品,应这样选择制剂中铵盐和 / 或磷盐的浓度,使得制剂被稀释至所需有效成分浓度后,铵盐和 / 或磷盐的浓度在上述一般的、优选的或特别优选的范围内。所述盐在制剂中的浓度通常为 1 重量% -50 重量%。

[0519] 在本发明的一个优选实施方案中,通过向作物保护组合物中不仅加入一种铵盐和 / 或磷盐,而且另外加入一种渗透剂而使活性增加。认为完全令人惊讶的是,甚至在这些情况下观察到更大的活性增强。本发明因此同样提供渗透剂和铵盐和 / 或磷盐的组合用于增强作物保护组合物活性的用途,所述作物保护组合物含有杀虫的 3' - 烷氧基螺环戊基取代的特特拉姆酸和特窗酸作为活性化合物。本发明同样提供含有除草和 / 或杀螨虫和 / 或杀昆虫的 3' - 烷氧基螺环戊基取代的特特拉姆酸和特窗酸、渗透剂和铵盐和 / 或磷盐的组合物,所述组合物具体地不仅包括制剂形式的活性化合物,而且还包括即用组合物(喷洒液)。最后,本发明另外还提供这些组合物在防治害虫中的用途。

[0520] 本发明中合适的渗透剂包括所有那些通常用于促进活性农用化学品化合物向植物中渗透的物质。本发明上下文中渗透剂是根据它们从含水喷洒液和 / 或喷洒层向植物表皮中渗透并由此提高活性化合物在表皮中移动性的能力定义的。可使用文献(Baur 等人, 1997, Pesticide Science 51, 131-152) 中记载的方法测定这种性能。

[0521] 合适渗透剂的实例包括烷醇烷氧基化物。本发明的渗透剂是式(IV') 的烷醇烷氧基化物



[0523] 其中

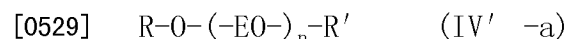
[0524] R 代表具有 4 至 20 个碳原子的直链或支链的烷基,

[0525] R' 代表氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、正戊基或正己基,

[0526] AO 代表氧乙烯基团、氧丙烯基团、氧丁烯基团,或者为氧乙烯与氧丙烯基团或氧丁烯基团的混合,并且

[0527] v 代表一个 2 至 30 的数字。

[0528] 一组优选的渗透剂是下式的烷醇烷氧基化物



[0530] 其中

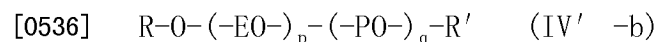
[0531] R 如上定义,

[0532] R' 如上定义,

[0533] EO 代表 $-CH_2-CH_2-O-$, 并且

[0534] n 代表一个 2 至 20 的数字。

[0535] 另一组优选的渗透剂为下式的烷醇烷氧基化物



[0537] 其中

[0538] R 如上定义,

[0539] R' 如上定义,

[0540] E0 代表 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$,

[0541] PO 代表
$$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---O---} \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array},$$

[0542] p 代表一个 1 至 10 的数字, 并且

[0543] q 代表一个 1 至 10 的数字。

[0544] 另一组优选的渗透剂为下式的烷醇烷氧基化物

[0545] $\text{R-O-}(-\text{PO-})_r(-\text{EO-})_s\text{-R}'$ (IV' -c)

[0546] 其中

[0547] R 如上定义,

[0548] R' 如上定义,

[0549] E0 代表 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$,

[0550] PO 代表
$$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---O---} \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array},$$

[0551] r 代表一个 1 至 10 的数字, 并且

[0552] s 代表一个 1 至 10 的数字。

[0553] 另一组优选的渗透剂为下式的烷醇烷氧基化物

[0554] $\text{R-O-}(-\text{EO-})_p(-\text{BO-})_q\text{-R}'$ (IV' -d)

[0555] 其中

[0556] R 和 R' 如上定义,

[0557] E0 代表 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$, 并且

[0558] BO 代表
$$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH---O---} \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array},$$

[0559] p 代表一个 1 至 10 的数字, 并且

[0560] q 代表一个 1 至 10 的数字。

[0561] 另一组优选的渗透剂为下式的烷醇烷氧基化物

[0562] $\text{R-O-}(-\text{BO-})_r(-\text{EO-})_s\text{-R}'$ (IV' -e)

[0563] 其中

[0564] R 和 R' 如上定义,

[0565] BO 代表
$$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH---O---} \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array},$$

[0566] E0 代表 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$,

[0567] r 代表一个 1 至 10 的数字, 并且

[0568] s 代表一个 1 至 10 的数字。

[0569] 另一组优选的渗透剂为下式的烷醇烷氧基化物

[0570] $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_t\text{-CH}_2\text{-O-}(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O-})_u\text{-R}'$ (IV' -f)

[0571] 其中

[0572] R' 如上定义，

[0573] t 代表一个 8 至 13 的数字，

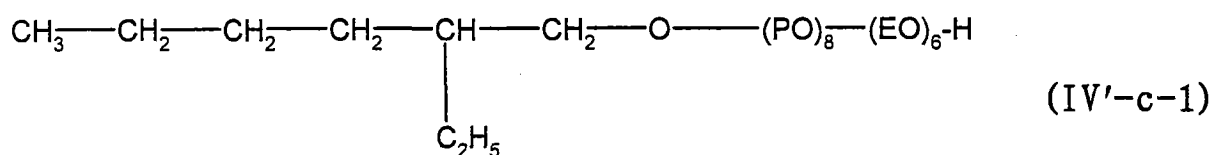
[0574] u 代表一个 6 至 17 的数字。

[0575] 在上述式中，

[0576] R 优选代表丁基、异丁基、正戊基、异戊基、新戊基、正己基、异己基、正辛基、异辛基、2-乙基己基、壬基、异壬基、癸基、正十二烷基、异十二烷基、月桂基、十四烷基、异十三烷基、三甲基壬基、十六烷基、十八烷基 (stearyl) 或二十烷基。

[0577] 作为式 (IV' -c) 的烷醇烷氧基化物的一个实例，可提及下式的 2-乙基己基烷氧基化物

[0578]



[0579] 其中

[0580] EO 代表 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$,

[0581] PO 代表 $\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---O---} \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array}$ 并且 ,

[0582] 数字 8 和 6 代表平均值。

[0583] 作为式 (IV' -d) 的烷醇烷氧基化物的一个实例，可提及下式

[0584] $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_{10}-\text{O}-(-\text{EO}-)_6-(-\text{BO}-)_2-\text{CH}_3$ (IV' -d-1)

[0585] 其中

[0586] EO 代表 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$,

[0587] BO 代表 $\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH---O---} \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array}$, 并且

[0588] 数字 10、6 和 2 代表平均值。

[0589] 特别优选的式 (IV' -f) 烷醇烷氧基化物是这样的该式化合物，其中，

[0590] t 代表一个 9 至 12 的数字，并且

[0591] u 代表一个 7 至 9 的数字。

[0592] 极特别优选可提及的是式 (IV' -f-1) 的烷醇烷氧基化物

[0593] $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_t-\text{CH}_2-\text{O}-(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-)_u-\text{H}$ (IV' -f-1)

[0594] 其中

[0595] t 代表平均值 10.5, 并且

[0596] u 代表平均值 8.4。

[0597] 烷醇烷氧基化物的宽泛定义由上式给出。这些物质是具有不同链长的所述类型化合物的混合物。因此，下标具有也可能偏离整数的平均值。

[0598] 所述式的烷醇烷氧基化物是已知的，并且在一些情况下是市售的，或者可通过已知方法制备 (参见 WO 98/35 553、WO 00/35 278 和 EP-A0 681 865)。

[0599] 合适的渗透剂还包括,例如,提高喷洒层中式(I)化合物的利用度的物质。这些物质包括,例如,矿物油或植物油。合适的油为所有通常用于农用化学组合物中的改性的或未改性的矿物油或植物油。可以实例的方式提及葵花油、菜籽油(rape seed oil)、橄榄油、蓖麻油、菜油(colza oil)、玉米籽油、棉籽油和大豆油,或者所述油的酯类。优选菜籽油、葵花油及它们的甲酯或乙酯。

[0600] 渗透剂在本发明组合物中的浓度可在较宽范围内变化。如果是制剂形式的作物保护组合物,浓度以重量计通常为1%至95%,优选1%至55%,更优选15%至40%。在即用组合物(喷洒液)中,浓度通常为0.1至10g/l,优选为0.5至5g/l。

[0601] 本发明的作物保护组合物还可包括其它组分,例如表面活性剂和/或分散助剂或乳化剂。

[0602] 合适的非离子表面活性剂和/或分散助剂包括所有通常可用于农用化学组合物中的此类物质。优选提及聚环氧乙烷-聚环氧丙烷嵌段共聚物,直链醇的聚乙二醇醚,脂肪酸与环氧乙烷和/或环氧丙烷的反应产物,以及聚乙烯醇、聚乙烯吡咯烷酮、聚乙烯醇与聚乙烯吡咯烷酮的共聚物,以及(甲基)丙烯酸与(甲基)丙烯酸酯的共聚物,以及另外还有烷基乙氧基化物和烷基芳基乙氧基化物;所有上述物质任选可被磷酸化,并且任选可用碱中和,可通过实例的方式提及山梨醇乙氧基化物以及聚氧化烯胺衍生物(polyoxyalkylenamine derivative)。

[0603] 合适的阴离子表面活性剂包括所有通常可用于农用化学组合物中的此类物质。优选烷基磺酸或烷基芳基磺酸的碱金属盐和碱土金属盐。

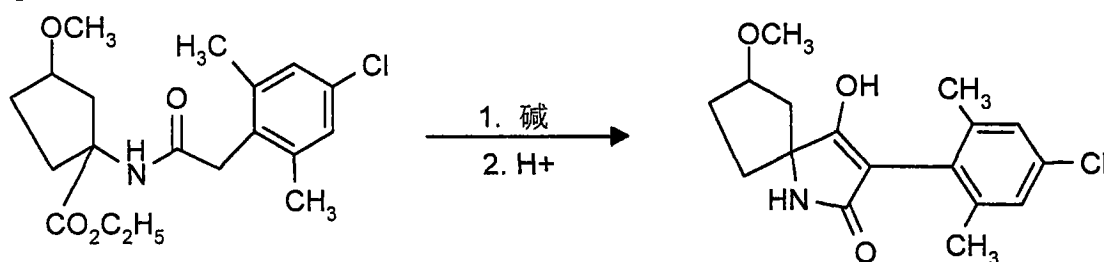
[0604] 另一组优选的阴离子表面活性剂和/或分散助剂是以下在植物油中具有低溶解度的盐:聚苯乙烯磺酸的盐、聚乙烯磺酸的盐、萘磺酸-甲醛缩合产物的盐,萘磺酸、苯酚磺酸和甲醛的缩合产物的盐,以及木质素磺酸的盐。

[0605] 可包括在本发明制剂中的合适的添加剂有:乳化剂、抑泡剂、防腐剂、抗氧化剂、着色剂和惰性填料。

[0606] 优选的乳化剂为乙氧基化壬基酚,烷基酚与环氧乙烷和/或环氧丙烷的反应产物,乙氧基化芳基烷基酚,以及乙氧基化和丙氧基化芳基烷基酚,以及硫酸化或磷酸化的芳基烷基乙氧基化物和/或芳基烷基乙氧基丙氧基化物;可通过实例的方式提及脱水山梨醇衍生物,例如聚环氧乙烷-脱水山梨醇脂肪酸酯,以及脱水山梨醇脂肪酸酯。

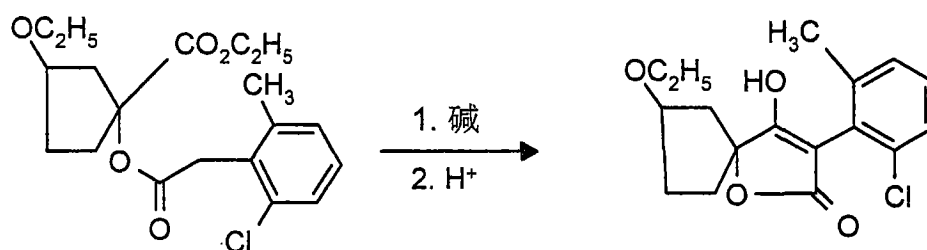
[0607] 例如,根据方法(A),使用N-[(4-氯-2,6-二甲基)苯基乙酰基]-1-氨基-3-甲氧基环戊羧酸乙酯作为原料,本发明方法的过程可由以下反应路线表示:

[0608]



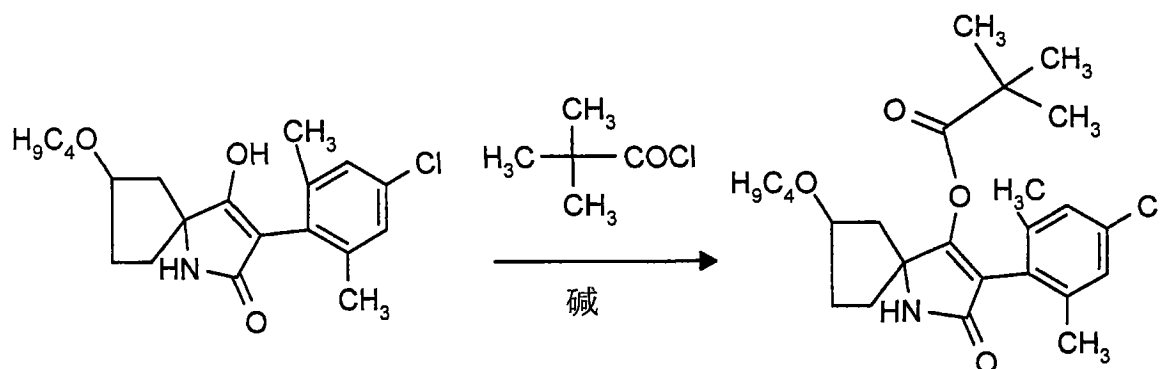
[0609] 例如,根据方法(B),使用O-[(2-氯-6-甲基)苯基乙酰基]-1-羟基-3-乙氧基环戊羧酸乙酯,本发明方法的过程可由以下反应路线表示:

[0610]



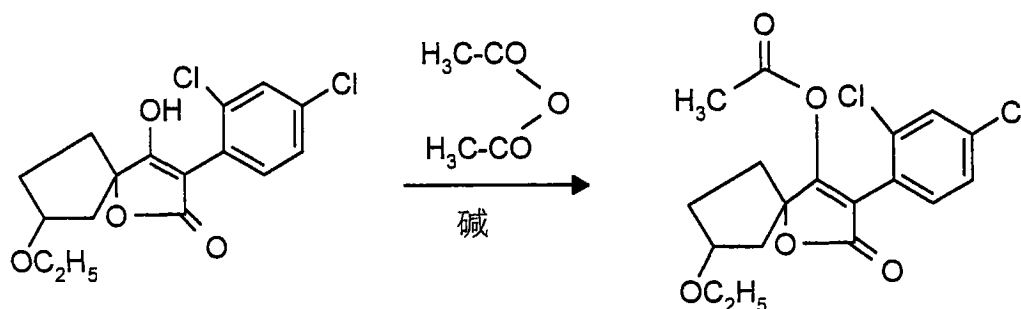
[0611] 例如,根据方法 (C α),使用 7-丁氧基-3-[(4-氯-2,6-二甲基)苯基]-1-氮杂螺[4,4]壬-2,4-二酮和新戊酰氯作为原料,本发明方法的过程可由以下反应路线表示:

[0612]



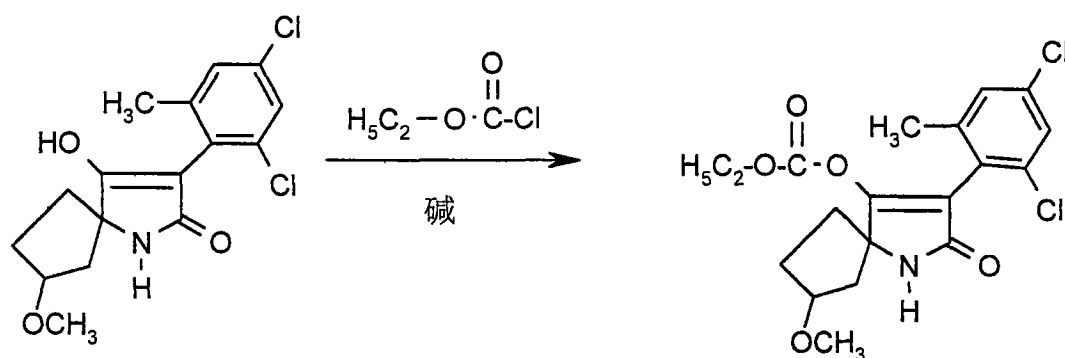
[0613] 例如,根据方法 (C) (β 变型),使用 7-乙氧基-3-[(2,4-(二氯)苯基)-1-氧杂螺[4,4]壬-2,4-二酮和乙酸酐作为原料,本发明方法的过程可由以下反应路线表示:

[0614]



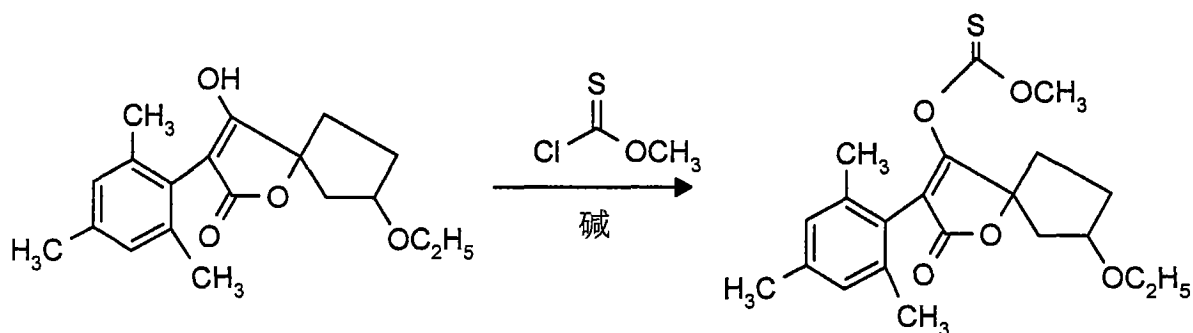
[0615] 例如,根据方法 (D),使用 7-甲氧基-3-[(2,4-二氯-6-甲基)-苯基]-1-氮杂螺[4,4]壬-2,4-二酮和氯甲酸乙酯作为原料,本发明方法的过程可由以下反应路线表示:

[0616]



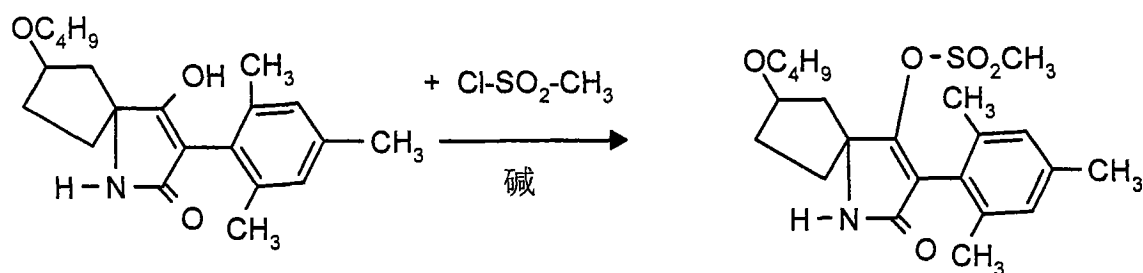
[0617] 例如,根据方法 (E),使用 7-乙氧基-3-[(2,4,6-三甲基)苯基]-1-氧杂螺[4,4]壬-2,4-二酮和氯代一硫代甲酸甲酯作为原料,反应的过程可如下表示:

[0618]



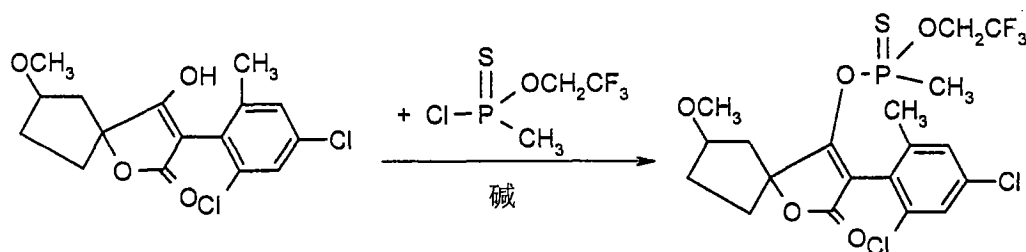
[0619] 例如,根据方法(F),使用 7-丁氧基-3-[(2,4,6-三甲基)苯基]-1-氮杂螺[4,4]壬-2,4-二酮和甲磺酰氯作为原料,反应的过程可由以下反应路线表示:

[0620]



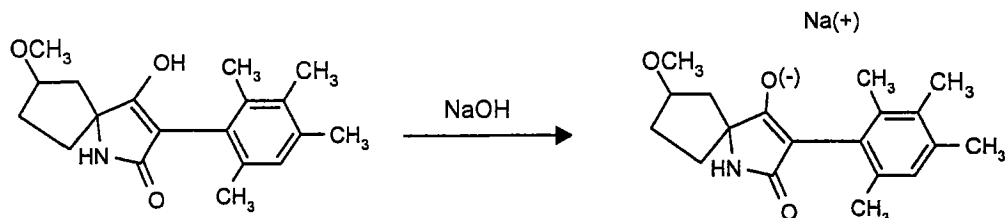
[0621] 例如,根据方法(G),使用 7-甲氧基-3-[(2,4-二氯-6-甲基)-苯基]-1-氧杂螺[4,4]壬-2,4-二酮和甲硫代膦酰氯 2,2,2-三氟乙酯作为原料,反应的过程可由以下反应路线表示:

[0622]



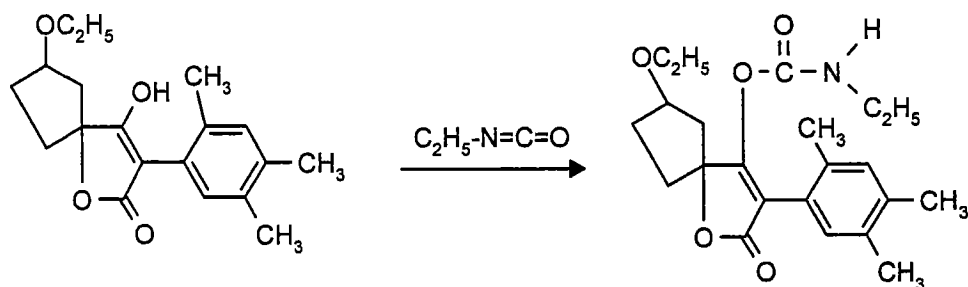
[0623] 例如,根据方法(H),使用 7-甲氧基-3-[(2,3,4,6-四甲基苯基)-1-氮杂螺[4,4]壬-2,4-二酮和 NaOH 作为组分,本发明方法的过程可由以下反应路线表示:

[0624]



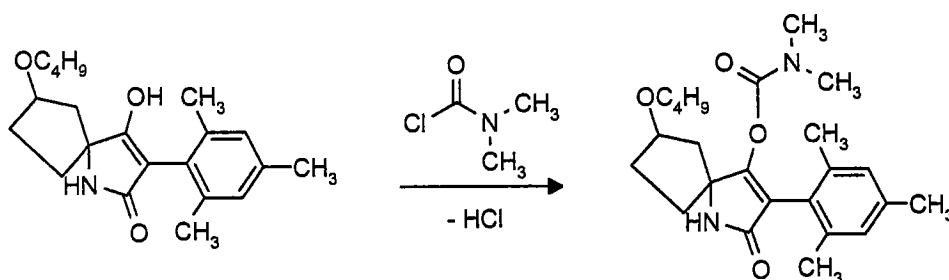
[0625] 例如,根据方法(I)(α变型),使用 7-乙氧基-3-[(2,4,5-三甲基)苯基]-1-氧杂螺[4,4]壬-2,4-二酮和异氰酸乙酯作为原料,反应的过程可由以下反应路线表示:

[0626]



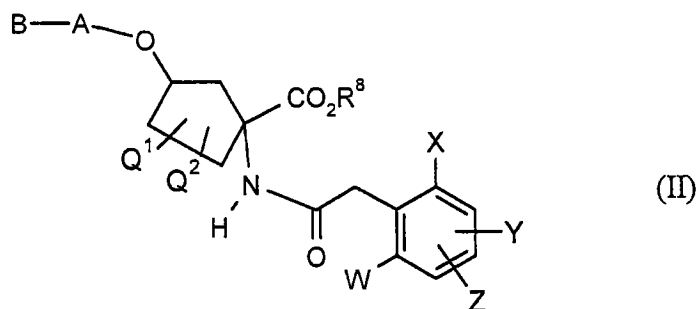
[0627] 例如,根据方法(I)(β 变型),使用7-丁氧基-3-[(2,4,6-三甲基)苯基]-1-氮杂螺[4,4]壬-2,4-二酮和二甲氨基甲酰氯作为原料,反应的过程可由以下反应路线表示:

[0628]



[0629] 本发明方法(A)所需原料式(II)化合物是新的

[0630]



[0631] 其中

[0632] A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z 和 R⁸ 如上文定义。

[0633] 例如,当式(XIV)氨基酸衍生物,获得式(II)的酰基氨基酸酯

[0634] U、W、X、Y 和 Z 如上文中定义,

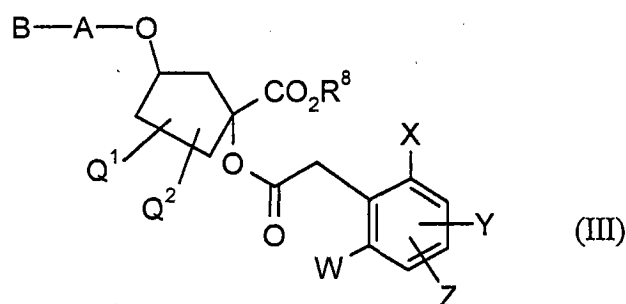
[0635] 根据 Schotten-Baumann (Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, 第 505 页)

[0636] 一些式(XV)化合物是已知的,并且/或者它们可通过开篇引述的公开出版物中的已知方法制备。

[0637] 一些式(XIV)和(XVII)化合物是新的,它们可通过已知方法制备 (Tetrahedron Assymetry, 8, 825 ff(1997) 和 WO 02/46128)。

[0638] 本发明方法(B)所需原料式(III)化合物是新的

[0639]



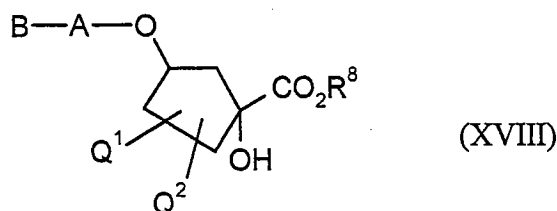
[0640] 其中

[0641] A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z 和 R⁸ 如上文中定义。

[0642] 它们可通过原理已知的方法简单地制备。

[0643] 例如当式 (XVIII) 的 1-羟基环己羧酸酯用式 (XV) 的取代的苯乙酸衍生物酰化时,可获得式 (III) 化合物 (Chem. Reviews 52, 237-416 (1953))

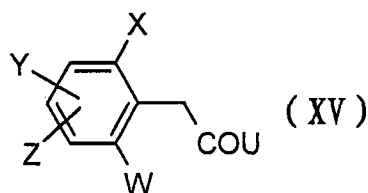
[0644]



[0645] 其中

[0646] A、B、Q¹、Q² 和 R⁸ 如本文中定义,

[0647]



[0648] 其中

[0649] U、W、X、Y 和 Z 如上文中定义。

[0650] 式 (XVIII) 的 1-羟基-3-烷氧基环戊基羧酸酯是新的。例如当取代的 1-羟基-3-烷氧基环戊烷甲腈在酸的存在下——例如根据 Pinner——与醇进行反应时,获得式 (XVIII)。羟腈可例如通过将取代的 3-烷氧基环戊-1-酮与氢氰酸反应而获得。

[0651] 实施本发明方法 (C)、(D)、(E)、(F)、(G)、(H) 和 (I) 还需要的原料式 (IV) 的酰基卤、式 (V) 的羧酸酐、式 (VI) 的氯甲酸酯或氯甲酸硫酸酯、式 (VII) 的氯代单硫代甲酸酯或氯代二硫代甲酸酯、式 (VIII) 的磺酰氯、式 (IX) 的磷化合物以及式 (X) 的金属氢氧化物、金属醇盐及式 (XI) 的胺,以及式 (XII) 的异氰酸酯和式 (XIII) 的氨基甲酰氯是有机化学或无机化学中普遍已知的化合物。

[0652] 另外,式 (XV) 化合物由开篇引述的专利申请中已知,并且 / 或者可通过其中给出的方法制备。

[0653] 方法 (A) 的特征在于其中 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z 和 R⁸ 如上文中定义的式 (II) 化合物在一种稀释剂的存在下并且在一种碱的存在下进行分子内缩合。

[0654] 适用于本发明方法 (A) 的稀释剂为所有对反应参与物惰性的有机溶剂。优选使用烃, 例如甲苯和二甲苯; 还有醚, 例如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲醚和二甘醇二甲醚; 还有极性溶剂, 例如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和 N-甲基吡咯烷酮; 以及醇, 例如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

[0655] 适用于实施本发明方法 (A) 的碱 (脱质子剂) 为所有常规质子接受体。优选使用碱金属和碱土金属的氧化物、氢氧化物和碳酸盐, 例如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙, 上述化合物也可在相转移催化剂的存在下使用, 所述催化剂例如氯化三乙基苄基铵、溴化四丁基铵、Adogen 464 (即氯化甲基三烷基 (C_8-C_{10}) 铵) 或 TDA 1 (即三 (甲氧基乙氧基乙基) 胺)。也可使用碱金属, 例如钠或钾。另外, 还可采用碱金属和碱土金属的氮化物和氢化物, 例如氮化钠、氢化钠和氢化钙, 以及碱金属醇盐, 例如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

[0656] 实施本发明的方法 (A) 时, 反应温度可在相对较宽的范围内变化。一般而言, 该方法在 -75°C 至 200°C 、优选 -50°C 至 150°C 的温度下实施。

[0657] 本发明的方法 (A) 通常在大气压下实施。

[0658] 实施本发明的方法 (A) 时, 式 (II) 反应组分和脱质子碱通常以等摩尔至约双倍摩尔的量使用。然而, 也可使一种组分或另一种组分用量相对大量过量 (最高达 3mol)。

[0659] 方法 (B) 的特征在于, 其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、W、X、Y、Z 和 R^8 如上文中定义的式 (III) 化合物在一种稀释剂的存在下, 以及在一种碱的存在下进行分子内缩合。

[0660] 适用于本发明方法 (B) 的稀释剂为所有对反应参与物惰性的有机溶剂。优选使用烃, 例如甲苯和二甲苯; 还有醚, 例如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲醚和二甘醇二甲醚; 还有极性溶剂, 例如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和 N-甲基吡咯烷酮。另外还可使用醇, 例如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

[0661] 适用于实施本发明方法 (B) 的碱 (脱质子剂) 为所有常规质子受体。优选使用碱金属和碱土金属的氧化物、氢氧化物和碳酸盐, 例如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙, 上述化合物也可在相转移催化剂的存在下使用, 所述催化剂例如氯化三乙基苄基铵、溴化四丁基铵、Adogen 464 (即氯化甲基三烷基 (C_8-C_{10}) 铵) 或 TDA 1 (即三 (甲氧基乙氧基乙基) 胺)。也可使用碱金属, 例如钠或钾。另外, 还可使用碱金属和碱土金属的氮化物和氢化物, 例如氮化钠、氢化钠和氢化钙, 以及碱金属醇盐, 例如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

[0662] 实施本发明的方法 (B) 时, 反应温度可在相对宽的范围内变化。一般而言, 该方法在 -75°C 至 200°C 、优选 -50°C 至 150°C 的温度下实施。

[0663] 本发明的方法 (B) 通常在大气压下实施。

[0664] 实施本发明的方法 (B) 时, 式 (III) 的反应组分和脱质子碱通常以约等摩尔的量使用。然而, 也可使一种组分或另一种组分用量相对大量过量 (最高达 3mol)。

[0665] 方法 (C α) 的特征在于, 如果合适在稀释剂的存在下, 并且如果合适在酸结合剂的存在下, 式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物各自与式 (IV) 的碳酰卤反应。

[0666] 适用于本发明方法 (C α) 的稀释剂为所有对上述酰基卤惰性的溶剂。优选使用烃, 例如汽油、苯、甲苯、二甲苯和 1,2,3,4-四氢化萘; 还有卤代烃, 例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、氯苯和邻二氯苯; 还有酮, 例如丙酮和甲基异丙基酮; 另外还有醚, 例如乙醚、四氢

呋喃和二噁烷；还有羧酸酯，例如乙酸乙酯；以及强极性溶剂，例如二甲基甲酰胺、二甲亚砜和环丁砜。如果酰基卤对水解足够稳定，则该反应也可在水的存在下进行。

[0667] 适用于本发明方法 (C α) 的酸结合剂为所有常规酸受体。优选使用叔胺，例如三乙胺、吡啶、二氮杂双环辛烷 (DABCO)、二氮杂双环十一烯 (DBU)、二氮杂双环壬烯 (DBN)、Hünig 碱和 N,N-二甲基苯胺；以及碱土金属氧化物，例如氧化镁和氧化钙；还有碱金属和碱土金属的碳酸盐，例如碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙；以及碱金属氢氧化物，例如氢氧化钠和氢氧化钾。

[0668] 本发明方法 (C α) 中，反应温度可在相对宽的范围内变化。一般而言，该方法在 -20°C 至 +150°C、优选 0°C 至 100°C 的温度下实施。

[0669] 实施本发明的方法 (C α) 时，式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 原料和式 (IV) 碳酰卤通常各自以约等当量的量使用。然而，也可使用相对大量过量（最高达 5mol）的碳酰卤。后处理通过常规方法进行。

[0670] 方法 (C β) 的特征在于，如果合适在稀释剂的存在下，并且如果合适在酸结合剂的存在下，式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物各自与式 (V) 的羧酸酐反应。

[0671] 适用于本发明方法 (C β) 的稀释剂优选为使用酰基卤时也优选的稀释剂。此外，过量的羧酸酐也可同时用作稀释剂。

[0672] 在方法 (C β) 中如果合适时加入的适合的酸结合剂优选为使用酰基卤时也优选的酸结合剂。

[0673] 本发明方法 (C β) 的反应温度可在相对宽的范围内变化。一般而言，该方法在 -20°C 至 +150°C、优选 0°C 至 100°C 的温度下实施。

[0674] 实施本发明的方法 (C β) 时，式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的原料和式 (V) 羧酸酐通常各自以约等当量的量使用。然而，也可使用相对大量过量（最高达 5mol）的羧酸酐。后处理通过常规方法进行。

[0675] 一般而言，稀释剂和过量羧酸酐以及生成的羧酸通过蒸馏除去，或用有机溶剂或用水洗涤除去。

[0676] 方法 (D) 的特征在于，如果合适在稀释剂的存在下，并且如果合适在酸结合剂的存在下，式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物各自与式 (VI) 的氯代甲酸酯或氯代甲酸硫酸酯反应。

[0677] 适用于本发明方法 (D) 的结合剂为所有常规酸受体。优选使用叔胺，例如三乙胺、吡啶、DABCO、DBU、DBN、Hünig 碱和 N,N-二甲基苯胺；还有碱土金属氧化物，例如氧化镁和氧化钙；以及碱金属和碱土金属的碳酸盐，例如碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙；以及碱金属氢氧化物，例如氢氧化钠和氢氧化钾。

[0678] 适用于本发明方法 (D) 的稀释剂为所有对上述氯代甲酸酯或氯代甲酸硫酸酯惰性的溶剂。优选使用烃，例如汽油、苯、甲苯、二甲苯和 1,2,3,4-四氢化萘；以及卤代烃，例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、氯苯和邻二氯苯；以及酮，例如丙酮和甲基异丙基酮；以及醚，例如乙醚、四氢呋喃和二噁烷；还有羧酸酯，例如乙酸乙酯；以及腈，例如乙腈；以及强极性溶剂，例如二甲基甲酰胺、二甲亚砜和环丁砜。

[0679] 实施本发明的方法 (D) 时，反应温度可在相对宽的范围内变化。一般而言，温度为 -20°C 至 +100°C，优选 0°C 至 50°C。

[0680] 本发明的方法 (D) 通常在大气压下实施。

[0681] 实施本发明的方法 (D) 时, 式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的原料和合适的式 (VI) 的氯代甲酸酯或氯代甲酸硫酯通常各自以约等当量的量使用。然而, 也可使一种组分或另一种组分用量相对大量过量 (最高达 2mol)。后处理通过常规方法进行。一般而言, 除去沉淀出的盐并通过减压下除去稀释剂而浓缩剩余的反应混合物。

[0682] 本发明方法 (E) 的特征在于, 在稀释剂的存在下并且如果合适在酸结合剂的存在下, 式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物各自与式 (VII) 化合物反应。

[0683] 在制备方法 (E) 中, 在 0 至 120°C、优选 20 至 60°C 下, 每摩尔式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的原料使用约 1mol 的式 (VII) 的氯代一硫代甲酸酯或氯代二硫代甲酸酯。

[0684] 如果合适加入的适合的稀释剂为所有惰性极性有机溶剂, 例如醚、酰胺、砜、亚砜以及卤代烷。

[0685] 优选使用二甲亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺、乙酸乙酯或二氯甲烷。

[0686] 在一个优选实施方案中, 如果通过加入强脱质子剂如氢化钠或叔丁醇钾来制备式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物的烯醇盐, 则可免除另外加入酸结合剂。

[0687] 适用于方法 (E) 的碱为所有常规质子受体。优选使用碱金属氢化物、碱金属醇盐、碱金属或碱土金属的碳酸盐或碳酸氢盐或氮碱。通过实例的方式可提及的有, 氢化钠、甲醇钠、氢氧化钠、氢氧化钙、碳酸钾、碳酸氢钠、三乙胺、二苄胺、二异丙胺、吡啶、喹啉、二氮杂双环辛烷 (DABCO)、二氮杂双环壬烯 (DBN) 和二氮杂双环十一烯 (DBU)。

[0688] 该反应可在大气压或在提高的压力下进行, 优选在大气压下进行。后处理通过常规方法进行。

[0689] 本发明的方法 (F) 的特征在于, 如果合适在稀释剂的存在下, 并且如果合适在酸结合剂的存在下, 式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物各自与式 (VIII) 磺酰氯反应。

[0690] 在制备方法 (F) 中, 在 -20 至 150°C、优选 0 至 70°C 下, 每摩尔式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的原料反应约 1mol 的式 (VIII) 磺酰氯。

[0691] 方法 (F) 优选在稀释剂的存在下实施。

[0692] 适合的稀释剂为所有惰性极性有机溶剂, 例如醚、酰胺、酮、羧酸酯、腈、砜、亚砜或卤代烃如二氯甲烷。

[0693] 优选使用二甲亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺、乙酸乙酯、二氯甲烷。

[0694] 在一个优选实施方案中, 如果通过加入强脱质子剂 (例如氢化钠或叔丁醇钾) 制备式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物的烯醇盐, 则可免除另外加入酸结合剂。

[0695] 如果使用酸结合剂, 则其为常规的无机或有机碱, 例如氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、吡啶和三乙胺。

[0696] 该反应可在大气压或在提高的压力下进行, 优选在大气压下进行。后处理通过常规方法进行。

[0697] 本发明方法 (G) 的特征在于, 如果合适在稀释剂的存在下, 并且如果合适在酸结合剂的存在下, 式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物各自与式 (IX) 的磷化合物反应。

[0698] 在制备方法 (G) 中, 为获得式 (I-1-e) 至 (I-2-e) 化合物, 在 -40°C 至 150°C、优选 -10°C 至 110°C 的温度下, 每摩尔式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物反应 1 至 2mol、优选 1 至 1.3mol 式 (IX) 的磷化合物。

[0699] 方法 (G) 优选在稀释剂的存在下实施。

[0700] 适合的稀释剂为所有惰性极性有机溶剂, 例如醚、羧酸酯、卤代烃、酮、酰胺、腈、砜、亚砜等。

[0701] 优选使用乙腈、二甲亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺、二氯甲烷。

[0702] 如果合适加入的适合的酸结合剂为常规的无机或有机碱, 例如氢氧化物、碳酸盐或胺。可提出的实例有氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、吡啶和三乙胺。

[0703] 该反应可在大气压或在提高的压力下进行, 优选在大气压下进行。后处理通过有机化学中的常规方法进行。最终产物优选通过结晶、色谱纯化或“早期蒸馏 (incipient distillation)”——即减压下除去挥发性组分——进行纯化。

[0704] 方法 (H) 的特征在于, 如果合适在稀释剂的存在下, 式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物各自与式 (X) 的金属氢氧化物或金属醇盐或者式 (XI) 的胺反应。

[0705] 适用于本发明方法 (H) 的稀释剂优选为醚, 例如四氢呋喃、二噁烷、乙醚; 或醇, 例如甲醇、乙醇、异丙醇; 以及水。本发明的方法 (H) 通常在大气压下实施。反应温度通常为 -20°C 至 100°C , 优选 0°C 至 50°C 。

[0706] 本发明方法 (I) 的特征在于, 式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的化合物各自 (I α) 与式 (XII) 的化合物反应, 该反应如果合适在稀释剂的存在下并且如果合适在催化剂的存在下进行; 或者 (I β) 与式 (XIII) 的化合物反应, 该反应如果合适在稀释剂的存在下并且如果合适在酸结合剂的存在下进行。

[0707] 在制备方法 (I α) 中, 在 0 至 100°C 、优选 20 至 50°C 下, 每摩尔式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的原料反应约 1mol 式 (XII) 的异氰酸酯。

[0708] 方法 (I α) 优选在稀释剂的存在下实施。

[0709] 适合的稀释剂为所有的惰性有机溶剂, 例如芳香烃、卤代烃、醚、酰胺、腈、砜或亚砜。

[0710] 如果合适, 可加入催化剂以加速反应。非常有利地适于用作催化剂的是有机锡化合物, 例如二月桂酸二丁基锡。

[0711] 该反应优选在大气压下进行。

[0712] 在制备方法 (I β) 中, 在 0 至 150°C 、优选 20 至 70°C 下, 每摩尔式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的起始化合物反应约 1mol 式 (XIII) 的氨基甲酰氯。

[0713] 如果合适加入的适合的稀释剂为所有的惰性极性有机溶剂, 例如醚、羧酸酯、腈、酮、酰胺、砜、亚砜或卤代烃。

[0714] 优选使用二甲亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺或二氯甲烷。

[0715] 在一个优选实施方案中, 如果通过加入强脱质子剂 (例如氢化钠或叔丁醇钾) 制备式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物的烯醇盐, 则可免除另外加入酸结合剂。

[0716] 如果使用酸结合剂, 则其为常规的无机或有机碱, 例如氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、三乙胺或吡啶。

[0717] 该反应可在大气压或在提高的压力下进行, 优选在大气压下进行。后处理通过常规方法进行。

[0718] 本发明的活性化合物兼具良好的植物耐受性和对温血动物有利的毒性以及良好的环境耐受性, 适用于保护植物和植物器官、提高采收产率、改进采收物的品质以及防治有

害动物,特别是农业、园艺、家畜饲养、森林、公园和休闲设施、贮存产品和材料保护以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。其可优选用作植物保护剂。它们对通常敏感和抗性物种以及全部或某些发育阶段具有活性。上述害虫包括:

[0719] 虱目 (Anoplura) (Phthiraptera), 例如 畜虱属 (*Damalinia* spp.)、血虱属 (*Haematopinus* spp.)、毛虱属 (*Linognathus* spp.)、虱属 (*Pediculus* spp.)、嚼虱属 (*Trichodectes* spp.)。

[0720] 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 (*Dermanyssus gallinae*)、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*。

[0721] 双壳软体动物 (Bivalva) 纲, 例如, *Dreissena* spp.。

[0722] 唇足目 (Chilopoda), 例如, 地蜈蚣属 (*Geophilus* spp.)、*Scutigera* spp.。

[0723] 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.)、*Cleonus mendicus*、宽胸叩头虫属 (*Conoderuss* pp.)、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 (*Lachnosternaconsanguinea*)、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 (*Oryzaeophilus 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.)。

[0724] 弹尾目 (*Collembola*)，例如，武装棘跳虫 (*Onychiurus armatus*)。

[0725] 革翅目 (*Dermaptera*)，例如，欧洲球螋 (*Forficula auricularia*)。

[0726] 倍足目 (*Diplopoda*)，例如，*Blaniulus guttulatus*。

[0727] 双翅目 (*Diptera*)，例如，伊蚊属 (*Aedes* spp.)、按蚊属 (*Anopheles* spp.)、花园毛蚊 (*Bibio hortulanus*)、红头丽蝇 (*Calliphora erythrocephala*)、地中海蜡实蝇 (*Ceratitis capitata*)、金蝇属 (*Chrysomya* spp.)、锥蝇属 (*Cochliomyia* spp.)、*Cordylobia anthropophaga*、库蚊属 (*Culex* spp.)、黄蝇属 (*Cuterebra* spp.)、橄榄大实蝇 (*Dacus oleae*)、人肤蝇 (*Dermatobia hominis*)、果蝇属 (*Drosophila* spp.)、厕蝇属 (*Fannia* spp.)、胃蝇属 (*Gastrophilus* spp.)、黑蝇属 (*Hylemyia* spp.)、*Hyppobosca* spp.、皮蝇属 (*Hypoderma* spp.)、斑潜蝇属 (*Liriomyza* spp.)、绿蝇属 (*Lucilia* spp.)、家蝇属 (*Musca* spp.)、绿蝽属 (*Nezara* spp.)、狂蝇属 (*Oestrus* spp.)、瑞典麦秆蝇 (*Oscinella frit*)、藜泉蝇 (*Pegomyia hyoscyami*)、草种蝇属 (*Phorbia* spp.)、螫蝇属 (*Stomoxys* spp.)、虻属 (*Tabanus* spp.)、*Tannia* spp.、欧洲大蚊 (*Tipula paludosa*)、污蝇属 (*Wohlfahrtia* spp.)。

[0728] 腹足纲 (*Gastropoda*)，例如，*Arion* spp.、双脐螺属 (*Biomphalaria* spp.)、小泡螺属 (*Bulinus* spp.)、*Deroceras* spp.、土蜗属 (*Galba* spp.)、椎实螺属 (*Lymnaea* spp.)、钉螺属 (*Oncomelania* spp.)、琥珀螺属 (*Succinea* spp.)。

[0729] 蠕虫纲 (*Helminths*)，例如，十二指肠钩口线虫 (*Ancylostoma duodenale*)、斯里兰卡钩口线虫 (*Ancylostoma ceylanicum*)、巴西钩口线虫 (*Ancylostoma 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 (*Echinococcus granulosus*)、多房棘球绦虫 (*Echinococcus multilocularis*)、蠕形住肠蛲虫 (*Enterobius vermicularis*)、*Faciola* spp.、血毛线虫属 (*Haemonchus* spp.)、异刺线虫属 (*Heterakis* spp.)、矮小啮壳绦虫 (*Hymenolepis nana*)、猪圆线虫属 (*Hyostromylus* 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.)、*Schistosoma* spp.、富氏类圆线虫 (*Strongyloides fuelleborni*)、粪类圆线虫 (*Strongyloides stercoralis*)、粪圆线虫属 (*Strongyloides* spp.)、牛带绦虫 (*Taenia saginata*)、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 (*Trichostrongylus* spp.)、*Trichuris trichuria*、班氏吴策线虫 (*Wuchereria bancrofti*)。

[0730] 此外,也可防治原生动物,例如艾美虫 (*Eimeria*)。

[0731] 异翅目 (*Heteroptera*),例如,南瓜缘蝽 (*Anasa tristis*)、拟丽蝽属 (*Antestiopsis* spp.)、土长蝽属 (*Blissus* spp.)、俊盲蝽属 (*Calocoris* spp.)、*Campylomma livida*、异背长蝽属 (*Cavelerius* spp.)、臭虫属 (*Cimex* spp.)、*Creontiades dilutus*、胡椒缘蝽 (*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.)、*Heliopectis* 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 (*Rhodnius* spp.)、可可褐盲蝽 (*Sahlbergella singularis*)、黑蝽属 (*Scotinophora* spp.)、梨冠网蝽 (*Stephanitis nashi*)、*Tibracasp.*、锥猎蝽属 (*Triatoma* spp.)。

[0732] 同翅目 (*Homoptera*),例如,无网长管蚜属 (*Acyrtosipon* spp.)、*Aeneolamia* spp.、隆脉木虱属 (*Agonosцена* 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 (*Aonidiellasp.*)、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 helichrysi*)、*Brachycolus* spp.、甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*)、小褐稻虱 (*Calligypona marginata*)、*Carneocephala fulgida*、甘蔗粉角蚜 (*Ceratovacuna lanigera*)、沫蝉科 (*Cercopidae*)、蜡蚧属 (*Ceroplastes* spp.)、草莓钉蚜 (*Chaetosiphon fragaefolii*)、蔗黄雪盾蚧 (*Chionaspis tegalensis*)、茶绿叶蝉 (*Chlorita onukii*)、核桃黑斑蚜 (*Chromaphis juglandicola*)、黑褐圆盾蚧 (*Chrysomphalus ficus*)、玉米叶蝉 (*Cicadulina mbila*)、*Cocomytilus halli*、软蚧属 (*Coccus* spp.)、茶蔗隐瘤蚜 (*Cryptomyzus ribis*)、*Dalbulus* spp.、*Dialeurodes* spp.、*Diaphorina* spp.、白背盾蚧属 (*Diaspis* spp.)、*Doralis* spp.、履绵蚧属 (*Drosicha* spp.)、西圆尾蚜属 (*Dysaphis* spp.)、灰粉蚧属 (*Dysmicoccus* spp.)、小绿叶蝉属 (*Empoasca* spp.)、绵蚜属 (*Eriosoma* spp.)、*Erythroneura* spp.、*Euscelis bilobatus*、咖啡地粉蚧 (*Geococcus coffeae*)、假桃病毒叶蝉 (*Homalodisca coagulata*)、梅大尾蚜 (*Hyalopterus arundinis*)、吹绵蚧属 (*Icerya* spp.)、片角叶蝉属 (*Idiocerus* spp.)、扁喙叶蝉属 (*Idioscopus* spp.)、灰飞虱 (*Laodelphax striatellus*)、*Lecanium* spp.、蛎盾蚧属 (*Lepidosaphes* spp.)、萝卜蚜 (*Lipaphis erysimi*)、长管蚜属 (*Macrosiphum* spp.)、*Mahanarva fimbriolata*、高粱蚜 (*Melanaphis sacchari*)、*Metcalfiella* spp.、麦无网蚜 (*Metopolophium dirhodum*)、黑缘平翅斑蚜 (*Monellia costalis*)、*Monelliopsis pecanis*、瘤蚜属 (*Myzus*

s pp.)、莒荳衲长管蚜 (*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 (*Pinnaspi saspidistrae*)、臀纹粉蚧属 (*Planococcus* spp.)、梨形原绵蚧 (*Protopulvinariapyriformis*)、桑白盾蚧 (*Pseudaulacaspis pentagona*)、粉蚧属 (*Pseudococcus* spp.)、木虱属 (*Psylla* spp.)、金小蜂属 (*Pteromalus* spp.)、*Pyrilla* spp.、笠圆盾蚧属 (*Quadraspidotus* spp.)、*Quesadagigas*、平刺粉蚧属 (*Rastrococcus* spp.)、缢管蚜属 (*Rhopalosiphum* spp.)、黑盔蚧属 (*Saissetia* spp.)、*Scaphoides titanus*、麦二叉蚜 (*Schizaphis graminum*)、苏铁刺圆盾蚧 (*Selenaspidus articulatus*)、长唇基飞虱属 (*Sogatata* spp.)、白背飞虱 (*Sogatella furcifera*)、*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 (*Triozia* spp.)、小叶蝉属 (*Typhlocyba* spp.)、尖盾蚧属 (*Unaspis* spp.)、*Viteus vitifolii*。

[0733] 膜翅目 (Hymenoptera)，例如，松叶蜂属 (*Diprion* spp.)、实叶蜂属 (*Hoplocampa* spp.)、毛蚁属 (*Lasius* spp.)、小家蚁 (*Monomorium pharaonis*)、胡蜂属 (*Vespa* spp.)。

[0734] 等足目 (Isopoda)，例如，鼠妇 (*Armadillidium vulgare*)、栉水虱 (*Oniscus asellus*)、球鼠妇 (*Porcellio scaber*)。

[0735] 等翅目 (Isoptera)，例如，散白蚁属 (*Reticulitermes* spp.)、土白蚁属 (*Odontotermes* spp.)。

[0736] 鳞翅目 (Lepidoptera)，例如，桑剑纹夜蛾 (*Acronicta major*)、烦夜蛾 (*Aedia leucomelas*)、地老虎属 (*Agrotis* spp.)、棉叶波纹夜蛾 (*Alabama argillacea*)、干煞夜蛾属 (*Anticarsia* spp.)、*Barathra brassicae*、棉潜蛾 (*Bucculatrix thurberiella*)、松尺蠖 (*Bupalus piniarius*)、亚麻黄卷蛾 (*Cacoecia podana*)、*Capua reticulana*、苹果小卷蛾 (*Carpocapsa pomonella*)、冬尺蛾 (*Cheimatobia brumata*)、禾草螟属 (*Chilo* spp.)、枞色卷蛾 (*Choristoneura fumiferana*)、葡萄果蠹蛾 (*Clysia ambiguella*)、*Cnaphalocerus* spp.、埃及金刚钻 (*Earias insulana*)、地中海粉斑螟 (*Ephestia kuehniella*)、黄毒蛾 (*Euproctis chrysorrhoea*)、切根虫属 (*Euxoa* spp.)、脏切夜蛾属 (*Feltia* spp.)、大蜡螟 (*Galleria mellonella*)、*Helicoverpa* spp.、实夜蛾属 (*Heliothis* spp.)、褐织蛾 (*Hofmannophila pseudospretella*)、茶长卷蛾 (*Homona magnanima*)、苹果巢蛾 (*Hyponomeuta padella*)、贪夜蛾属 (*Laphygma* spp.)、苹细蛾 (*Lithocolletis blancardella*)、绿果冬夜蛾 (*Lithophane antennata*)、豆白隆切根虫 (*Loxagrotis albicosta*)、毒蛾属 (*Lymantria* spp.)、黄褐天幕毛虫 (*Malacosoma neustria*)、甘蓝夜蛾 (*Mamestra brassicae*)、稻毛胫夜蛾 (*Mocis repanda*)、粘虫 (*Mythimna separata*)、*Oria* spp.、水稻负泥虫 (*Oulema oryzae*)、小眼夜蛾 (*Panolis flammea*)、红铃麦蛾 (*Pectinophora gossypiella*)、桔潜蛾 (*Phyllocnistis citrella*)、菜粉蝶属 (*Pieris* spp.)、菜蛾 (*Plutella xylostella*)、斜纹夜蛾属 (*Prodenia* spp.)、*Pseudaletia* spp.、

大豆夜蛾 (*Pseudoplusia includens*)、玉米螟 (*Pyraustanubilalis*)、灰翅夜蛾属 (*Spodoptera* spp.)、*Thermesia gemmatilis*、袋谷蛾 (*Tinea pellionella*)、幕谷蛾 (*Tineola bisselliella*)、栎绿卷蛾 (*Tortrix viridana*)、粉夜蛾属 (*Trichoplusia* spp.)。

[0737] 直翅目 (Orthoptera), 例如, 家蟋 (*Acheta domesticus*)、东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*)、德国蠊 (*Blattella germanica*)、蝼蛄属 (*Gryllotalpa* spp.)、马德拉蜚蠊 (*Leucophaea maderae*)、飞蝗属 (*Locusta* spp.)、黑蝗属 (*Melanoplus* spp.)、美洲大蠊 (*Periplaneta americana*)、沙漠蝗 (*Schistocerca gregaria*)。

[0738] 蚤目 (Siphonaptera), 例如, 角叶蚤属 (*Ceratophyllus* spp.)、印鼠客蚤 (*Xenopsylla cheopis*)。

[0739] 综合目 (Symphyla), 例如, *Scutigera* *immaculata*。

[0740] 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.)、温室条蓟马 (*Hercinothrips femoralis*)、卡蓟马属 (*Kakothrips* spp.)、葡萄蓟马 (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、硬蓟马属 (*Scirtothrips* spp.)、*Taeniothrips cardamoni*、蓟马属 (*Thrips* spp.)。

[0741] 缨尾目 (Thysanura), 例如, 衣鱼 (*Lepisma saccharina*)。

[0742] 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 (*Ditylenchus dipsaci*)、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 (*Radopholus similis*)、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 (*Tylenchulus semipenetrans*)、剑线虫属 (*Xiphinema* spp.)。

[0743] 如果合适, 本发明的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, 或者用作改善植物特性的药剂, 或者用作杀微生物剂, 例如杀真菌剂、抗霉剂、杀细菌剂、杀病毒剂 (包括对抗无壳病毒的药剂) 或用作对抗 MLO (类支原体) 和 RLO (类立克次氏体) 的药剂。如果合适, 它们也可用作合成其它活性化合物的中间体或前体。

[0744] 所有的植物及植物部位均可依据本发明予以处理。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培育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, 也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, 例如枝条、叶、花和根, 可提及的实例为叶、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以及无性与有性繁殖物, 例如插枝、块茎、根茎、幼枝和种子。

[0745] 根据本发明的使用活性化合物对植物和植物部位进行的处理, 通过常规处理方法直接进行或者通过使化合物作用于其所处环境、生境或储存空间来实现, 所述常规处理方法例如浸液、喷雾、蒸发、弥雾、撒播、涂抹、注射, 并且, 对于繁殖材料, 尤其是种子, 还可包

衣一层或多层。

[0746] 本发明的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、撒施颗粒剂、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。

[0747] 这些制剂以已知的方式制成,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,同时可任选使用表面活性剂,即乳化剂和/或分散剂和/或发泡剂。这些制剂可在适当的装置中制备,或者在施用之前或在施用过程中制备。

[0748] 适用作助剂的是适用于赋予组合物本身和/或由其得到的制剂(例如喷洒液、拌种剂)以特殊性能——如某些工艺特性和/或特定的生物学特性——的物质。典型的合适的助剂有:填充剂、溶剂和载体。

[0749] 合适的填充剂有,例如水,极性的和非极性的有机化学液体,例如芳香烃和非芳香烃类的极性的和非极性的有机化学液体(如石蜡、烷基苯、烷基萘、氯苯)、醇和多元醇(如果合适,可以是被取代的、醚化的和/或酯化的)、酮(如丙酮、环己酮)、酯(包括脂肪和油)以及(聚)醚、未取代的和取代的胺、酰胺、内酰胺(如N-烷基吡咯烷酮)和内酯,砜和亚砜(如二甲亚砜)。

[0750] 如果使用水作为填充剂,还可使用例如有机溶剂作为助溶剂。合适的液体溶剂主要有:芳香族化合物,例如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯代芳香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,例如石油馏分、矿物油和植物油;醇,例如丁醇或乙二醇,及它们的醚和酯;酮,例如丙酮、甲乙酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂如二甲亚砜;以及水。

[0751] 适合的固体载体有:

[0752] 例如,铵盐和天然矿物粉,例如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、凹凸棒石、蒙脱石或硅藻土,以及合成矿物粉末,例如高度分散的二氧化硅、氧化铝和硅酸盐;适用于颗粒剂的固体载体为: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,及合成的无机和有机粉末的颗粒以及有机物质的颗粒,例如纸、锯屑、椰壳、玉米穗轴和烟草茎;适合的乳化剂和/或发泡剂为:例如非离子和阴离子乳化剂,例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、芳基磺酸盐及蛋白质水解产物;适合的分散剂为非离子性和/或离子性物质,例如以下种类的物质:醇-POE-和/或-POP-醚,酸和/或POP-POE酯,烷基芳基和/或POP-POE醚,脂肪-和/或POP-POE加成物,POE-和/或POP-多元醇衍生物,POE-和/或POP-脱水山梨醇-或-糖加成物,烷基或芳基硫酸盐,烷基-或芳基磺酸盐,以及烷基或芳基磷酸盐或者相应的PO-醚加成物。此外,合适的低聚物或高聚物,例如由乙烯单体形成的、由丙烯酸形成的低聚物或高聚物,由EO和/或PO单独形成的或与如(多元)醇或(多元)胺组合形成的低聚物或高聚物。还可采用木质素及其磺酸衍生物,未改性的和改性的纤维素、芳香的和/或脂族磺酸及它们与甲醛的加成物。

[0753] 制剂中可使用增粘剂,例如羧甲基纤维素;以及粉末、颗粒或胶乳形式的天然及合成聚合物,例如阿拉伯树胶、聚乙烯醇及聚乙酸乙烯酯;以及天然磷脂,例如脑磷脂和卵磷脂,以及合成磷脂。

[0754] 可使用着色剂,例如无机颜料——如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝,有机染料——如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料,以及微量营养物——如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐。

[0755] 其它可能的添加剂有香料、任选改性的矿物油或植物油、蜡和营养物(包括微量营养物)如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌盐。

[0756] 还可含有稳定剂,例如低温稳定剂、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂或者其它改进化学和/或物理稳定性的试剂。

[0757] 制剂通常包括 0.01 至 98 重量%、优选 0.5 至 90 重量%的活性化合物。

[0758] 本发明的活性化合物可在其市售制剂中和在由所述制剂制备的使用形式中作为与其它活性化合物的混合物使用,所述其它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、生长调节物质、除草剂、安全剂、肥料或化学信息物质。

[0759] 特别有利的混合组分有,例如以下化合物:

[0760] 杀真菌剂:

[0761] 核酸合成抑制剂

[0762] 苯霜灵(benalaxyl)、高效苯霜灵(benalaxyl-M)、磺嘧菌灵(bupirimate)、chiralaxyl、clozylacon、甲菌定(dimethirimol)、乙菌定(ethirimol)、呋氨基灵(furalaxyl)、恶霜灵(hymexazol)、甲霜灵(metalaxyl)、精甲霜灵(metalaxyl-M)、甲呋酰胺(ofurace)、噁霜灵(oxadixyl)、喹菌酮(oxolinic acid)

[0763] 有丝分裂和细胞分裂抑制剂

[0764] 苯菌灵(benomyl)、多菌灵(carbendazim)、乙霉威(diethofencarb)、麦穗宁(fuberidazole)、戊菌隆(pencycuron)、噻菌灵(thiabendazole)、甲基托布津(thiophanate-methyl)、苯酰菌胺(zoxamide)

[0765] 呼吸链复合体 I 抑制剂

[0766] 氟嘧菌胺(diflumerimorim)

[0767] 呼吸链复合体 II 抑制剂

[0768] 啉酰菌胺(boscalid)、羧锈灵(carboxin)、甲呋酰胺(fenfuram)、氟酰胺(flutolanil)、呋吡唑灵(furametpyr)、灭锈胺(mepronil)、氧化羧锈灵(oxycarboxin)、吡噻菌胺(penthiopyrad)、噻氟唑菌(thifluzamide)

[0769] 呼吸链复合体 III 抑制剂

[0770] 嘧菌酯(azoxystrobin)、氰霜唑(cyazofamid)、醚菌胺(dimoxystrobin)、enestrobin、噁唑酮菌(famoxadone)、咪唑菌酮(fenamidone)、氟嘧菌酯(fluxastrobin)、醚菌酯(kresoxim-methyl)、苯氧菌胺(metominostrobin)、肟醚菌胺(orysastrobin)、唑菌胺酯(pyraclastrobin)、啉氧菌酯(picoxystrobin)、肟菌酯(trifloxystrobin)

[0771] 解偶联剂(decoupler)

[0772] 敌螨普(dinocap)、氟啉胺(fluazinam)

[0773] ATP 生成抑制剂

[0774] 薯瘟锡(fentin acetate)、三苯锡氯(fentin chloride)、毒菌锡(fentin

hydroxide)、硅噻菌胺 (silthiofam)

[0775] 氨基酸生物合成和蛋白质生物合成抑制剂

[0776] 胺扑灭 (andoprim)、灭瘟素 (blasticidin-S)、噻菌环胺 (cyprodinil)、春雷霉素 (kasugamycin)、春雷霉素水合盐酸盐 (kasugamycin hydrochloride hydrate)、噻菌胺 (mepanipyrim)、噻霉胺 (pyrimethanil)

[0777] 信号转导抑制剂

[0778] 拌种咯 (fenpiclonil)、咯菌腈 (fludioxonil)、苯氧喹啉 (quinoxifen)

[0779] 脂类和膜合成抑制剂

[0780] 乙菌利 (chlozolate)、异菌脲 (iprodione)、腐霉利 (procymidone)、乙烯菌核利 (vinclozolin)

[0781] 氨丙膦酸 (ampropylfos)、氨丙膦酸钾 (potassium-ampropylfos)、敌瘟磷 (edifenphos)、异稻瘟净 (iprobenfos) (IBP)、稻瘟灵 (isoprothiolane)、吡菌磷 (pyrazophos)

[0782] 甲基立枯磷 (tolclofos-methyl)、联苯

[0783] iodocarb、霜霉威 (propamocarb)、霜霉威盐酸盐 (propamocarbhydrochloride)、

[0784] 麦角甾醇生物合成抑制剂

[0785] 环酰菌胺 (fenhexamid)、

[0786] 氧环唑 (azaconazole)、联苯三唑醇 (bitertanol)、糠菌唑 (bromuconazole)、环丙唑醇 (cyproconazole)、苄氯三唑醇 (diclobutrazole)、苯醚甲环唑 (difenoconazole)、烯唑醇 (diniconazole)、R-烯唑醇 (diniconazole-M)、氟环唑 (epoxiconazole)、乙环唑 (etaconazole)、腈苯唑 (fenbuconazole)、氟唑唑 (fluquinconazole)、氟硅唑 (flusilazole)、粉唑醇 (flutriafol)、呋菌唑 (furconazole)、呋唑唑 (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)、烯霜苄唑 (voriconazole)、抑霉唑 (imazalil)、烯菌灵 (imazalil sulphate)、恶咪唑 (oxpoconazole)、氯苯嘧啶醇 (fenarimol)、呋唑醇 (flurprimidole)、氟苯嘧啶醇 (nuarimol)、啉斑肟 (pyrifenoxy)、啉氨灵 (triforine)、稻瘟酯 (pefurazoate)、咪鲜胺 (prochloraz)、氟菌唑 (triflumizole)、烯霜苯唑 (viniconazole),

[0787] 4-十二烷基-2,6-二甲基吗啉 (aldimorph)、十二环吗啉 (dodemorph)、吗菌灵 (dodemorph acetate)、丁苯吗啉 (fenpropimorph)、十三吗啉 (tridemorph)、苯锈啉 (fenpropidin)、螺环菌胺 (spiroxamine),

[0788] 萘替芬 (naftifine)、稗草丹 (pyributicarb)、特比萘芬 (terbinafine)

[0789] 细胞壁合成抑制剂

[0790] 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 (validamycinA)

[0791] 黑色素生物合成抑制剂

[0792] 环丙酰菌胺 (capropamid)、双氯氰菌胺 (diclocymet)、氰菌胺 (fenoxanil)、四氯苯酞 (phthalid)、咯嗪酮 (pyroquilon)、三环唑 (tricyclazole)

[0793] 抗性诱导剂

[0794] 苯并噻二唑 (acibenzolar-S-methyl)、烯丙苯噻唑 (probenazole)、噻酰菌胺 (tiadinil)

[0795] 多位点

[0796] 敌菌丹 (captafol)、克菌丹 (captan)、百菌清 (chlorothalonil)、铜盐, 如: 氢氧化铜、环烷酸铜、氧氯化铜、硫酸铜、氧化铜、喹啉铜 (oxine-copper), 以及波尔多液 (Bordeaux mixture)、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)、双胍盐 (guazatine)、双胍辛乙酸盐 (guazatine acetate)、双胍辛胺 (iminooctadine)、双八胍盐 (iminooctadine albesilate)、双胍辛胺乙酸盐 (iminooctadinetriacetate)、代森锰铜 (mancopper)、代森锰锌 (mancozeb)、代森锰 (maneb)、代森联 (metiram, metiram zinc)、丙森锌 (propineb)、硫和包括多硫化钙的硫制剂、福美双 (thiram)、甲苯氟磺胺 (tolyfluanid)、代森锌 (zineb)、福美锌 (ziram)

[0797] 作用机理未知

[0798] 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)、吡菌酮 (diclomezine)、双氯酚 (dichlorophen)、氯硝胺 (dicloran)、野燕枯 (difenzoquat)、苯敌快 (difenzoquat methyl sulfate)、二苯胺 (diphenylamine)、噻唑菌胺 (ethaboxam)、噻菌胺 (ferimzone)、氟酰菌胺 (flumetover)、磺菌胺 (flusulfamide)、氟吡菌胺 (fluopicolide)、氟氯菌核利 (fluoroimide)、六氯苯 (hexachlorobenzene)、8-羟基喹啉 (8-hydroxyquinoline sulfate)、人间霉素 (irumamycin)、磺菌威 (methasulfocarb)、苯菌酮 (metrafenone)、异硫氰酸甲酯、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), 以及 2,3,5,6-四氯-4-(甲磺酰基)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-茛-4-基)-3-吡啶甲酰胺、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基异噻唑烷-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-茛-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]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-氯代吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯烟酰胺、N-(5-溴-3-氯代吡啶-2-基)甲基-2,4-二氯烟酰胺、2-丁氧基-6-碘代-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- α E-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)环丙甲酰胺、1-[(4-甲氧基苯氧基)甲基]-2,2-二甲基丙基-1H-咪唑-1-甲酸、0-{1-[(4-甲氧基苯氧基)甲基]-2,2-二甲基丙基}-1H-咪唑-1-硫代羧酸、2-(2-{[6-(3-氯-2-甲基苯氧基)-5-氟嘧啶-4-基]氧基}苯基)-2-(甲氧亚氨基)-N-甲基乙酰胺

[0799] 杀细菌剂：

[0800] 溴硝醇 (bronopol)、双氯酚、三氯甲基吡啶 (nitrapyrin)、福美镍、春雷霉素、辛噻酮、羧酸呋喃 (furancarboxylic acid)、土霉素 (oxytetracycline)、烯丙苯噻唑、链霉素 (streptomycin)、叶枯酞、硫酸铜和其它铜制剂。

[0801] 杀昆虫剂 / 杀螨剂 / 杀线虫剂：

[0802] 乙酰胆碱酯酶 (AChE) 抑制剂

[0803] 氨基甲酸酯类，

[0804] 例如，棉铃威 (alanycarb)、涕灭威 (aldicarb)、涕灭砒威 (aldoxycarb)、除害威 (allyxycarb)、灭害成 (aminocarb)、噁虫威 (bendiocarb)、丙硫克百威 (benfuracarb)、合杀威 (bufencarb)、畜虫威 (butacarb)、丁酮威 (butocarboxim)、丁酮砒威 (butoxycarboxim)、甲萘威 (carbaryl)、克百威 (carbofuran)、丁硫克百威 (carbosulfan)、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 (isoprocab)、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)、灭除威 (XMC)、灭杀威 (xylylcarb)、啮蚜威 (triazamate)

[0805] 有机磷酸酯类，

[0806] 例如，乙酰甲胺磷 (acephate)、甲基吡恶磷 (azamethiphos)、保棉磷 (azinphos-methyl)、益棉磷 (azinphos-ethyl)、乙基溴硫磷 (bromophos-ethyl)、溴苯烯磷 (bromfenvinfos(-methyl))、特噻硫磷 (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)、毒死蜱 (chlorpyrifos-ethyl)、蝇毒磷 (coumaphos)、苯腈磷 (cyanofenphos)、杀螟腈 (cyanophos)、毒虫畏、甲基内吸磷 (demeton-S-methyl)、砒吸磷 (demeton-S-methylsulfone)、氯亚胺硫磷 (dialifos)、二嗪磷 (diazinon)、除线磷 (dichlofenthion)、敌敌畏 /DDVP (dichlorvos/DDVP)、百治磷 (dicrotophos)、乐果 (dimethoate)、甲基毒虫畏 (dimethylvinphos)、蔬果磷 (dioxabenzofos)、乙拌磷 (disulfoton)、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、氯唑磷 (isazofos)、异柳磷 (isofenphos)、O-水杨酸异丙酯、恶唑磷 (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)、氧乐果 (omethoate)、亚砒磷 (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)、辛硫磷 (phoxim)、甲基嘧啶磷 (pirimiphos-methyl)、嘧啶磷 (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)、哒硫磷 (pyridathion)、喹硫磷 (quinalphos)、硫线磷 (sebufos)、治螟磷 (sulfotep)、硫丙磷 (sulprofos)、丁基嘧啶磷 (tebupirimphos)、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 (trichlorfon)、蚜灭磷 (vamidothion)

[0807] 钠通道调节剂 / 电位依赖性钠通道阻断剂

[0808] 拟除虫菊酯类,

[0809] 例如, 氟酯菊酯 (acrinathrin)、烯丙菊酯 (d-顺-反, d-反) (allethrin(d-cis-trans, d-trans))、 β -氟氯氰菊酯 (beta-cyfluthrin)、氟氯菊酯 (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)、右旋反灭虫菊酯 (bioresmethrin)、二氯炔戊菊酯 (chlovaporthrin)、顺式氯氰菊酯、顺式灭虫菊 (cis-resmethrin)、顺式氯菊酯 (cis-permethrin)、功夫菊酯 (clocythrins)、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-))、苯醚氯菊酯 (cyphenothrin)、溴氰菊酯 (deltamethrin)、烯炔菊酯 (1R 异构体) (empenthrin(1R isomer))、高氰戊菊酯 (esfenvalerate)、醚菊酯 (etofenprox)、五氟苯菊酯 (fenfluthrin)、甲氰菊酯 (fenpropathrin)、吡氯氰菊酯 (fenpyrithrin)、灭杀菊酯 (fenvalerate)、溴氟菊酯 (flubrocycythrinate)、氟氰戊菊酯 (flucythrinate)、氟丙苯醚 (flufenprox)、氟氯苯菊酯 (flumethrin)、氟胺氰菊酯 (fluvalinate)、氟丙苯醚 (fubfenprox)、 γ -氯氟氰菊酯 (gamma-cyhalothrin)、炔咪菊酯 (imiprothrin)、噻恩菊酯 (kadethrin)、 λ -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(1Rtrans-isomer)、炔酮菊酯 (prallethrin)、丙氟菊酯 (profluthrin)、protrifenbute、反灭虫菊 (pyresmethrin)、灭虫菊、RU 15525、氟硅菊酯 (silaflluofen)、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(1Risomer))、四溴菊酯 (tralomethrin)、四氟菊酯 (transfluthrin)、ZXI 8901、除虫菊素 (pyrethrin, pyrethrum))

[0810] DDT

[0811] 噁二嗪类,

[0812] 例如茚虫威 (indoxacarb)

[0813] 缩氨基脒类,

[0814] 例如氰氟虫胺 (metaflumizone, BAS 3201)

[0815] 乙酰胆碱受体激动剂 / 拮抗剂

[0816] 氯烟碱基类 (chloronicotinyl),

[0817] 例如, 啉虫脒 (acetamiprid)、噁虫胺 (clothianidin)、呋虫胺 (dinotefuran)、吡虫啉 (imidacloprid)、烯啶虫胺 (nitenpyram)、硝虫噻嗪 (nithiazine)、噁虫啉 (thiacloprid)、噁虫嗪 (thiamethoxam)

[0818] 烟碱 (nicotine)、杀虫磺 (bensultap)、杀螟丹 (cartap)

[0819] 乙酰胆碱受体调节剂

[0820] spinosyn 类,

[0821] 例如多杀菌素 (spinosad)

[0822] GABA 受控氯离子通道拮抗剂

[0823] 有机氯类,

[0824] 例如, 毒杀芬 (camphechlor)、氯丹 (chlordane)、硫丹 (endosulfan)、林丹 (gamma-HCH)、HCH、七氯 (heptachlor)、林丹 (lindane)、甲氧滴滴涕 (methoxychlor)

[0825] 苯基吡唑类 (fiproles)

[0826] 例如, acetoprole、乙虫腈 (ethiprole)、氟虫腈 (fipronil)、pyrafluprole、pyripole、氟吡唑虫 (vaniliprole)

[0827] 氯离子通道活化剂类

[0828] mectin 类

[0829] 例如, 阿维菌素 (avermectin)、埃玛菌素 (emamectin)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐 (emamectin-benzoate)、伊维菌素 (ivermectin)、米尔倍霉素 (milbemycin)

[0830] 保幼激素模拟物类,

[0831] 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)

[0832] 蜕皮激素激动剂 / 干扰剂类 (disruptor)

[0833] 二酰基肼类,

[0834] 例如, 环虫酰肼 (chromafenozide)、氯虫酰肼 (halofenozide)、甲氧虫酰肼

(methoxyfenozide)、虫酰肼 (tebufenozide)

[0835] 几丁质生物合成抑制剂

[0836] 苯甲酰脲类,

[0837] 例如, 双三氟虫脲 (bistrifluron)、定虫隆 (chlorfluazuron)、氟脲杀 (diflubenzuron)、氟啶蜱脲 (fluazuron)、氟螨脲 (flucycloxuron)、氟虫脲 (flufenoxuron)、氟铃脲 (hexaflumuron)、氟丙氧脲 (lufenuron)、双苯氟脲 (novaluron)、多氟脲 (noviflumuron)、氟幼脲 (penfluron)、伏虫磷 (teflubenzuron)、杀虫隆 (triflumuron)

[0838] 噻嗪酮 (buprofezin)

[0839] 灭蝇胺 (cyromazine)

[0840] 氧化磷酸化抑制剂, ATP 干扰剂类

[0841] 丁醚脲 (diafenthiuron)

[0842] 有机锡化合物类,

[0843] 例如三唑锡 (azocyclotin)、三环锡 (cyhexatin)、苯丁锡 (fenbutatin-oxide)

[0844] 通过打断 H⁺ 质子梯度而起作用的氧化磷酸化解偶联剂类

[0845] 吡咯类,

[0846] 例如虫螨腈 (chlorfenapyr)

[0847] 二硝基苯酚类,

[0848] 例如乐杀螨 (binapacryl)、消螨通 (dinobuton)、敌螨普 (dinocap)、DNOC

[0849] 位点 -I (site-I) 电子转移抑制剂类

[0850] METI 类,

[0851] 例如啞螨醚 (fenazaquin)、啞螨酯 (fenpyroximate)、啞螨醚 (pyrimidifen)、啞螨灵 (pyridaben)、啞螨胺 (tebufenpyrad)、啞虫酰胺 (tolfenpyrad)

[0852] 灭蚁腈 (hydramethylnon)

[0853] 三氯杀螨醇 (dicofol)

[0854] 位点 -II 电子转移抑制剂类

[0855] 鱼藤酮 (rotenone)

[0856] 位点 -III 电子转移抑制剂类

[0857] 灭螨醌 (acequinocyl)、啞螨酯 (fluacrypyrim)

[0858] 昆虫肠道膜微生物干扰剂类

[0859] 苏云金杆菌 (*Bacillus thuringiensis*) 菌株

[0860] 脂肪合成抑制剂类

[0861] 特窗酸类,

[0862] 例如, 螺螨酯 (spirodiclofen)、螺甲螨酯 (spiromesifen)

[0863] 特特拉姆酸类,

[0864] 例如螺虫乙酯 (spirotetramat)

[0865] 甲酰胺类,

[0866] 例如氟啶虫酰胺 (flonicamid)

[0867] 章鱼胺能激动剂类,

- [0868] 例如双甲脒 (amitraz)
- [0869] 镁刺激 ATP 酶抑制剂类,
- [0870] 炔螨特 (propargite)
- [0871] 兰诺定受体效应物 (ryanodine receptor effector) 类
- [0872] a) 苯甲酸二甲酰胺类,
- [0873] 例如氟虫酰胺 (flubendiamide)
- [0874] b) 邻氨基苯甲酰胺类 (anthranilamide) 类,例如
- [0875] Rynaxapyr (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)
- [0876] 沙蚕毒素类似物,
- [0877] 例如杀虫环草酸盐 (thiocyclam hydrogen oxalate)、杀虫双 (thiosultap-sodium)
- [0878] 生物制剂类、激素类或信息素类
- [0879] 印楝素 (azadirachtin)、芽孢杆菌类 (*Bacillus spec.*)、白僵菌类 (*Beauveria spec.*)、十二碳二烯醇 (codlemone)、绿僵菌属 (*Metarrhizium spec.*)、拟青霉属 (*Paecilomyces spec.*)、敌贝特 (thuringiensin)、轮枝菌属 (*Verticillium spec.*)
- [0880] 作用机理未知或不明确的活性化合物类
- [0881] 熏蒸剂类,
- [0882] 例如磷化铝、甲基溴、硫酰氟
- [0883] 拒食剂类,
- [0884] 例如冰晶石 (cryolite)、氟啉虫酰胺、吡蚜酮 (pymetrozine)
- [0885] 螨虫生长抑制剂类,
- [0886] 例如四螨嗪 (clofentezine)、乙螨唑 (etoxazole)、噻螨酮 (hexythiazox)
- [0887] amidoflumet、benclothiaz、苯螨特 (benzoximate)、联苯肼酯 (bifenazate)、溴螨酯 (bromopropylate)、噻嗪酮 (buprofezin)、灭螨锰、杀虫脒 (chlordimeform)、乙酯杀螨醇 (chlorobenzilate)、氯化苦、clothiazoben、cycloprene、cyflumetofen、环虫腈 (dicyclanil)、fenoxacrim、氟硝二苯胺 (fentrifanil)、flubenzimine、flufenerim、氟螨嗪 (flutenzin)、红铃虫性诱剂 (gossyplure)、伏虫脲、japonilure、恶虫酮 (metoxadiazone)、石油、增效醚 (piperonyl butoxide)、油酸钾 (potassium oleate)、啉虫丙醚 (pyridalyl)、氟虫胺 (sulfluramid)、三氯杀螨醇 (tetradifon)、杀螨硫醚 (tetrasul)、苯螨噻 (triarathene)、增效炔醚 (verbutin)
- [0888] 还可以是与其它已知活性化合物例如除草剂、肥料、生长调节剂、安全剂、化学信息物质、或与改善植物特性的药剂的混合物。
- [0889] 以市售制剂和由所述制剂制备的使用形式用作杀虫剂时,本发明的活性化合物也可以与增效剂混合的形式存在。增效剂为可提高活性化合物活性、而所加入的增效剂本身不一定具有活性的化合物。
- [0890] 以市售制剂和由所述制剂制备的使用形式用作杀虫剂时,本发明的活性化合物也可以与抑制剂混合的形式存在,所述抑制剂可在活性化合物用于植物的环境、植物部位表面或植物组织中后减少其降解。

[0891] 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 至 95 重量%的活性化合物,优选 0.00001 至 1 重量%。

[0892] 这些化合物以适合于使用形式的常规方式使用。

[0893] 如上所述,可依据本发明处理所有的植物和其部位。在一个优选实施方案中,处理了野生植物种和植物品种、或由常规生物育种方法例如杂交或原生质体融合获得的植物种和植物品种、以及所述植物种和植物品种的部位。在另一优选实施方案中,处理了由遗传工程方法、如果合适还可与常规方法相结合而获得的转基因植物和植物品种(遗传修饰的生物(genetic modified organism))及其部位。术语“部位”、“植物的部位”和“植物部位”解释如上。

[0894] 特别优选依据本发明处理各自市售或使用的植物品种的植株。植物品种的含义理解为由常规育种、诱变或重组 DNA 技术获得的具有新特性(“特征”)的植物。它们可以是品种、生物型(biotype)或基因型。

[0895] 依据植物种或植物品种、其种植地点和生长条件(土壤、气候、植物生长期、营养(diet)),本发明的处理也可产生超加和性(superadditive)(“协同的”)效应。由此可取得如下超过实际预期的效果,例如可降低本发明使用的物质和组合物的施用率和/或拓宽其活性谱和/或提高其活性、改善植物生长状况、提高高温或低温耐受性、提高对干旱或者对水中或土壤中含盐量的耐受性、提高开花品质、使采收更简易、加速成熟、提高采收产量、提高采收产品的质量和/或改善其营养价值、改善采收产品的贮存稳定性和/或其加工性能。

[0896] 优选的依据本发明处理的转基因植物或植物品种(通过遗传工程方法获得)包括通过遗传修饰而获得遗传物质的所有植物,所述遗传物质将特别有利的、有用的特征赋予所述植物。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、提高对干旱或者对水中或土壤中含盐量的耐受性、提高开花品质、使采收更简易、加速成熟、提高采收产量、提高采收产物的品质和/或提高其营养价值、改善采收产物的贮存稳定性和/或其加工性能。需特别强调的所述特征的其它实例有改善植物对有害动物和微生物的抵抗力,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。可提出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、番茄、豌豆以及其它蔬菜品种、棉花、烟草、油菜和果实植物(果实为苹果、梨、柑橘类果实和葡萄),特别强调的是玉米、大豆、马铃薯、棉花、烟草和油菜。尤其强调的特征为通过在植物体内形成毒素,特别是由苏云金杆菌的遗传物质(例如由基因 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、蛞蝓和腹足类动物的抵抗力(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、刺激素(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。尤其强调的其它特征为提高植物对某些除草活性化合物例如咪唑啉酮类、磺酰脲类、草甘膦或草丁膦(phosphinotricin)(例如“PAT”基因)的耐受性。赋予所述所想要特征的基因也可在转基因植物体内组合存在。可提出的“Bt 植物”的实例为市售的商标名称为 YIELD GARD®(例如玉米、棉花、大豆)、KnockOut®(例如玉米)、StarLink®(例如玉米)、Bollgard®(棉花)、Nucotn®(棉花)

和 **NewLeaf®** (马铃薯) 的玉米品种、棉花品种、大豆品种和马铃薯品种。可提出的具有除草剂耐受性的植物的实例为市售的商标名称为 Roundup **Ready®** (具有草甘膦耐受性, 例如玉米、棉花、大豆)、Liberty **Link®** (具有草丁膦耐受性, 例如油菜)、**IMI®** (具有咪唑啉酮耐受性) 和 **STS®** (具有磺酰脲耐受性, 例如玉米) 的玉米品种、棉花品种和大豆品种。还可提出的具有除草剂抗性的植物 (以常规的除草剂耐受性方式育种的植物) 包括名为 **Clearfield®** 的市售品种 (例如玉米)。当然, 以上叙述也适用于具有所述遗传特征或待开发的遗传特征的植物品种, 所述植物品种将在未来进行开发和 / 或上市。

[0897] 所列植物可以特别有利的方式用本发明的通式 I 化合物和 / 或活性化合物混合物根据本发明进行处理。上述活性化合物或混合物的优选范围也适用于对所述植物的处理。特别强调的为用本发明具体提出的化合物或混合物对植物进行处理。

[0898] 本发明的活性化合物不仅对有害植物、卫生和贮存产品有害物具有活性, 而且在兽医领域对动物寄生虫 (体外寄生虫和体内寄生虫) 例如硬蜱、软蜱、疥螨、叶螨、蝇 (叮咬和吸食)、寄生蝇幼虫、虱、毛虱、羽虱和蚤也具有活性。所述寄生虫包括:

[0899] 虱目 (Anoplurida), 例如血虱属 (*Haematopinus* spp.)、毛虱属 (*Linognathus* spp.)、虱属 (*Pediculus* spp.)、Phtirus spp.、管虱属 (*Solenopotes* spp.)

[0900] 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 (*Menopons* spp.)、巨羽虱属 (*Trinoton* spp.)、牛羽虱属 (*Bovicola* spp.)、*Werneckiella* spp.、*Lepikentron* spp.、畜虱属 (*Damalina* spp.)、嚼虱属 (*Trichodectes* spp.)、猫羽虱属 (*Felicola* spp.)

[0901] 双翅目及长角亚目 (Nematocera) 和短角亚目 (Brachycera), 例如伊蚊属 (*Aedes* spp.)、按蚊属 (*Anopheles* spp.)、库蚊属 (*Culex* spp.)、蚋属 (*Simulium* spp.)、真蚋属 (*Eusimulium* spp.)、白蛉属 (*Phlebotomus* spp.)、罗蛉属 (*Lutzomyia* spp.)、库蠓属 (*Culicoides* spp.)、斑虻属 (*Chrysops* spp.)、瘤虻属 (*Hybomitra* spp.)、黄虻属 (*Atylotus* spp.)、虻属 (*Tabanus* spp.)、麻虻属 (*Haematopota* spp.)、*Philipomyia* spp.、蜂虱蝇属 (*Braula* spp.)、家蝇属 (*Musca* spp.)、齿股蝇属 (*Hydrotaea* spp.)、螫蝇属 (*Stomoxys* spp.)、黑角蝇属 (*Haematobia* spp.)、莫蝇属 (*Morellia* spp.)、厕蝇属 (*Fannia* spp.)、舌蝇属 (*Glossina* spp.)、丽蝇属 (*Calliphora* spp.)、绿蝇属 (*Lucilia* spp.)、金蝇属 (*Chrysomya* spp.)、污蝇属 (*Wohlfahrtia* spp.)、麻蝇属 (*Sarcophaga* spp.)、狂蝇属 (*Oestrus* spp.)、皮蝇属 (*Hypoderma* spp.)、胃蝇属 (*Gasterophilus* spp.)、虱蝇属 (*Hippobosca* spp.)、羊虱蝇属 (*Lipoptena* spp.)、蜉蝣属 (*Melophagus* spp.)。

[0902] 蚤目 (Siphonaptera), 例如蚤属 (*Pulex* spp.)、栉首蚤属 (*Ctenocephalides* spp.)、客蚤属 (*Xenopsylla* spp.)、角叶蚤属 (*Ceratophyllus* spp.)。

[0903] 异翅目 (Heteroptera), 例如臭虫属 (*Cimex* spp.)、锥猎蝽属 (*Triatoma* spp.)、红猎蝽属 (*Rhodnius* spp.)、锥蝽属 (*Panstrongylus* spp.)。

[0904] 蜚蠊目 (Blattaria), 例如东方蜚蠊、美洲大蠊、德国蠊、夏柏拉蟑螂属 (*Supella* spp.)。

[0905] 蜱螨亚纲 (Acari 或 Acarina) 及后气门目 (Metastigmata) 和中气门目 (Mesostigmata), 例如锐缘蜱属 (*Argas* spp.)、钝缘蜱属 (*Ornithodoros* spp.)、残喙蜱属 (*Otobius* spp.)、硬蜱属 (*Ixodes* spp.)、花蜱属 (*Amblyomma* spp.)、牛蜱属 (*Boophilus*

spp.)、革蜱属 (*Dermacentor* spp.)、*Haemophysalis* spp.、璃眼蜱属 (*Hyalomma*spp.)、扇头蜱属 (*Rhipicephalus* spp.)、皮刺螨属 (*Dermanyssus*spp.)、刺利螨属 (*Raillietia* spp.)、肺刺螨属 (*Pneumonyssus* spp.)、胸刺螨属 (*Sternostoma* spp.)、蜂螨属 (*Varroa* spp.)。

[0906] 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 (*Acarapiss*spp.)、姬螯螨属 (*Cheyletiella* spp.)、禽螯螨属 (*Ornithocheyletiass*spp.)、肉螨属 (*Myobia* spp.)、疮螨属 (*Psorergates* spp.)、蠕形螨属 (*Demodex* spp.)、恙螨属 (*Trombicula* spp.)、*Listrophorus*spp.、粉螨属 (*Acarus* spp.)、食酪螨属 (*Tyrophagus* spp.)、嗜木螨属 (*Caloglyphus* spp.)、颈下螨属 (*Hypodectes* spp.)、翅螨属 (*Pterolichus* spp.)、痒螨属 (*Psoroptes* spp.)、皮螨属 (*Choriopress*spp.)、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.)。

[0907] 本发明的式 (I) 活性化合物也适用于防治侵害以下动物的节肢动物：农业生产家畜，例如黄牛、绵羊、山羊、马、猪、驴、骆驼、水牛、兔、家鸡、火鸡、鸭、鹅、蜜蜂，其它玩赏动物，例如狗、猫、笼鸟、观赏鱼，以及所谓的试验动物，例如仓鼠、豚鼠、大鼠和小鼠。通过防治所述节肢动物，应减少死亡和（肉、奶、毛、皮、蛋、蜜等的）产量降低的情况，从而可通过使用本发明的化合物使畜牧更经济、更简便。

[0908] 本发明的活性化合物以已知方式通过以下方式用于兽医领域和畜牧中：通过例如片剂、胶囊剂、口服剂、兽用顿服药、颗粒剂、膏剂、丸剂、喂服 (feed-through) 法、栓剂的方式进行肠内给药，可通过例如注射（肌内、皮下、静脉、腹膜内等）、植入进行肠外给药，可鼻部给药，可通过例如浸泡或沐浴、喷雾、泼浇和点滴、清洗、撒粉的形式，以及借助于包含活性化合物的模型制品、例如项圈、耳标、尾标、肢体缚带 (limb band)、笼头、标识器等进行皮肤给药。

[0909] 用于家畜、家禽、玩赏动物等时，式 (I) 的活性化合物可作为包括 1 至 80 重量%的活性化合物的制剂（例如粉剂、乳剂、可流动组合物）直接使用或稀释 100 至 10000 倍后使用，或可以化学药浴剂 (chemical bath) 形式使用。

[0910] 而且，已发现本发明的化合物还对毁坏工业材料的昆虫具有强杀昆虫作用。

[0911] 以实例并且优选的方式可非限制性地提出以下昆虫：

[0912] 甲虫，例如北美家天牛 (*Hylotrupes bajulus*)、*Chlorophorus pilosis*、家具窃蠹 (*Anobium punctatum*)、报死窃蠹 (*Xestobium rufovillosum*)、梳角细脉窃蠹 (*Ptilinus pecticornis*)、*Dendrobium pertinex*、松窃蠹 (*Ernobius mollis*)、*Priobium carpini*、褐粉蠹 (*Lyctus brunneus*)、非洲粉蠹 (*Lyctus africanus*)、南方粉蠹 (*Lyctus planicollis*)、栎粉蠹 (*Lyctus linearis*)、柔毛粉蠹 (*Lyctus pubescens*)、*Trogoxylon aequale*、鳞毛粉蠹 (*Minthes rugicollis*)、材小蠹种 (*Xyleborus spec.*)、*Tryptodendron spec.*、咖啡黑长蠹 (*Apate monachus*)、榲长蠹 (*Bostrychus capucins*)、褐异翅长蠹 (*Heterobostrychus brunneus*)、棘长蠹种 (*Sinoxylon spec.*)、竹长蠹 (*Dinoderus minutus*)；

[0913] 革翅目昆虫 (*Hymenopteron*)，例如大树蜂 (*Sirex juvenicus*)、枞大树蜂 (*Urocerus gigas*)、泰加大树蜂 (*Urocerus gigas taignus*)、*Urocerus augur*；

[0914] 白蚁，例如欧洲木白蚁 (*Kaloterms flavicollis*)、麻头堆砂白蚁

(*Cryptotermes brevis*)、灰点异白蚁 (*Heterotermes indicola*)、欧美散白蚁 (*Reticulitermes flavipes*)、桑特散白蚁 (*Reticulitermes santonensis*)、南欧网纹白蚁 (*Reticulitermes lucifugus*)、达尔文澳白蚁 (*Mastotermes darwiniensis*)、内华达古白蚁 (*Zootermopsis nevadensis*)、家白蚁 (*Coptotermes formosanus*) ;

[0915] 蠹虫 (*Bristletail*), 例如衣鱼 (*Lepisma saccharina*)。

[0916] 本发明中工业材料的含义应理解为非活体 (non-living) 材料, 例如, 优选为塑料、粘合剂、胶料、纸张和板材、皮革、木材和木材加工制品和涂料。

[0917] 即用的组合物, 如果合适, 还可包括其它的杀虫剂; 并且如果合适, 还可包括一种或多种杀菌剂。

[0918] 针对可能的额外的添加剂, 还可提及上述的杀虫剂和杀菌剂。

[0919] 本发明的化合物可同样用于保护与咸水或微咸水接触的物体, 例如船体、筛、网、建筑物、系泊设备及信号系统, 以防产生污垢。

[0920] 另外, 本发明的化合物还可单独或与其它活性化合物组合用作防污剂。

[0921] 在家庭、卫生和储存产品保护中, 活性化合物亦适于防治封闭空间内出现的有害动物, 特别是昆虫、蛛形纲动物和螨虫, 所述封闭空间例如住所、工厂车间、办公室、交通工具舱室等。它们可单独或与其他活性化合物和助剂组合用于防治所述害虫的家用杀虫产品中。它们对敏感和抗性物种以及全部发育阶段均具有活性。所述害虫包括:

[0922] 蝎目 (*Scorpionidea*), 例如地中海黄蝎 (*Buthus occitanus*)。

[0923] 蜱螨目 (*Acarina*), 例如波斯锐缘蜱 (*Argas persicus*)、鸽锐缘蜱 (*Argas reflexus*)、苔螨亚种 (*Bryobia* spp.)、鸡皮刺螨 (*Dermanyssus gallinae*)、家嗜甜螨 (*Glyciphagus domesticus*)、非洲钝缘蜱 (*Ornithodoros moubat*)、血红扇头蜱 (*Rhipicephalus sanguineus*)、阿氏真恙螨 (*Trombicula alfreddugesi*)、*Neutrombicula autumnalis*、特嗜皮螨 (*Dermatophagoides pteronissimus*)、法嗜皮螨 (*Dermatophagoides forinae*)。

[0924] 蜘蛛目 (*Araneae*), 例如捕鸟蛛 (*Aviculariidae*)、圆蛛 (*Araneidae*)。

[0925] 盲蛛目 (*Opiliones*), 例如螯蝎 (*Pseudoscorpiones chelifer*)、*Pseudoscorpiones cheiridium*、长跗盲蛛 (*Opiliones phalangium*)。

[0926] 等足目, 例如栉水虱、球鼠妇。

[0927] 倍足目, 例如 *Blaniulus guttulatus*、山蛰虫 (*Polydesmuss* pp.)。

[0928] 唇足目, 例如地蜈蚣 (*Geophilus* spp.)。

[0929] 衣鱼目 (*Zygentoma*), 例如栉衣鱼属 (*Ctenolepisma* spp.)、衣鱼、盗火虫 (*Lepismodes inquilinus*)。

[0930] 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*)。

[0931] 跳跃亚目 (*Saltatoria*), 例如家蟋。

[0932] 革翅目, 例如欧洲球蝮。

[0933] 等翅目, 例如木白蚁属 (*Kaloterms* spp.)、散白蚁属。

[0934] 啮虫目 (Psocoptera), 例如 *Lepinatus* spp.、粉啮虫属 (*Liposcelis* spp.)。

[0935] 鞘翅目, 例如圆皮蠹属、毛皮蠹属、皮蠹属、长头谷盗 (*Latheticusoryzae*)、隐跗郭公虫属 (*Necrobia* spp.)、蛛甲属、谷蠹、谷象 (*Sitophilus granarius*)、米象 (*Sitophilus oryzae*)、玉米象 (*Sitophilus zeamais*)、药材甲 (*Stegobium paniceum*)。

[0936] 双翅目, 例如埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*)、白纹伊蚊 (*Aedes albopictus*)、带喙伊蚊 (*Aedes taeniorhynchus*)、按蚊属、红头丽蝇、高额麻虻 (*Chrysozona pluvialis*)、五带淡色库蚊 (*Culex quinquefasciatus*)、尖音库蚊 (*Culex pipiens*)、环喙库蚊 (*Culex tarsalis*)、果蝇属 (*Drosophila* spp.)、夏厕蝇 (*Fannia canicularis*)、家蝇 (*Musca domestica*)、白蛉属、*Sarcophaga carnaria*、蚋属、厩螫蝇 (*Stomoxys calcitrans*)、欧洲大蚊。

[0937] 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。

[0938] 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。

[0939] 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*)。

[0940] 虱目 (Anoplura), 例如头虱 (*Pediculus humanus capitis*)、体虱 (*Pediculus humanus corporis*)、瘰绵蚜属、*Phylloeravastatrix*、阴虱 (*Phthirus pubis*)。

[0941] 异翅目, 例如热带臭虫 (*Cimex hemipterus*)、温带臭虫 (*Cimex lectularius*)、长红猎蝽 (*Rhodinus prolixus*)、侵扰锥猎蝽 (*Triatoma infestans*)。

[0942] 在家用杀虫剂领域, 它们可单独使用或者与其它合适的活性化合物组合使用, 上述合适的活性化合物例如磷酸酯、氨基甲酸酯、拟除虫菊酯、新烟碱类、生长调节剂或其它已知杀虫剂种类的活性化合物。

[0943] 它们可以以下产品的形式使用: 气雾剂、无压喷雾 (pressure-free spray) 产品例如泵及雾化器 (atomizer) 喷雾、自动弥雾系统、烟雾剂、泡沫剂、凝胶剂、具有由纤维素或聚合物制得的蒸发片 (evaporator tablet) 的蒸发产品、液体蒸发器、凝胶和薄膜蒸发剂、推进剂驱动的蒸发剂、无动力 (energy-free) 或无源 (passive) 蒸发系统、捕蛾纸、捕蛾袋和捕蛾胶, 以及作为颗粒剂或粉末剂用于抛撒的饵料中或毒饵站 (bait station) 中。

[0944] 本发明的活性化合物 / 活性化合物结合物也可用作脱叶剂、干燥剂、除茎叶剂 (haulm killer) 以及特别是除杂草剂。最广义的杂草的含义应理解为在不需要它们的地方生长的所有植物。本发明的物质用作非选择性还是选择性除草剂, 主要取决于施用率。

[0945] 本发明的活性化合物 / 活性化合物结合物可用于例如以下植物:

[0946] 以下属的双子叶杂茎: 白麻属 (*Abutilon*)、苋属 (*Amaranthus*)、豚草属 (*Ambrosia*)、*Anoda*、春黄菊属 (*Anthemis*)、*Aphanes*、滨藜属 (*Atriplex*)、雏菊属 (*Bellis*)、鬼针属 (*Bidens*)、芥属 (*Capsella*)、飞廉属 (*Carduus*)、决明属 (*Cassia*)、矢车菊属 (*Centaurea*)、藜属 (*Chenopodium*)、蓟属 (*Cirsium*)、旋花属 (*Convolvulus*)、曼陀罗属 (*Datura*)、山蚂蝗属 (*Desmodium*)、刺酸模属 (*Emex*)、糖芥属 (*Erysimum*)、大戟属 (*Euphorbia*)、鼬瓣花属 (*Galeopsis*)、牛膝菊属 (*Galinsoga*)、拉拉藤属 (*Galium*)、

芙蓉属 (Hibiscus)、番薯属 (Ipomoea)、地肤属 (Kochia)、野芝麻属 (Lamium)、独行菜属 (Lepidium)、母草属 (Lindernia)、母菊属 (Matricaria)、薄荷属 (Mentha)、山黧属 (Mercurialis)、Mullugo、勿忘我属 (Myosotis)、罂粟属 (Papaver)、牵牛属 (Pharbitis)、车前属 (Plantago)、蓼属 (Polygonum)、马齿苋属 (Portulaca)、毛茛属 (Ranunculus)、萝卜属 (Raphanus)、蔊菜属 (Rorippa)、节节菜属 (Rotala)、酸模属 (Rumex)、猪毛菜属 (Salsola)、千里光属 (Senecio)、田菁属 (Sesbania)、黄花稔属 (Sida)、白芥属 (Sinapis)、茄属 (Solanum)、苦苣菜属 (Sonchus)、尖瓣花属 (Sphenoclea)、繁缕属 (Stellaria)、蒲公英属 (Taraxacum)、荇菜属 (Thlaspi)、车轴草属 (Trifolium)、荨麻属 (Urtica)、婆婆纳属 (Veronica)、堇菜属 (Viola)、苍耳属 (Xanthium)。

[0947] 以下属的双子叶作物：花生属 (Arachis)、甜菜属 (Beta)、芸苔属 (Brassica)、黄瓜属 (Cucumis)、南瓜属 (Cucurbita)、向日葵属 (Helianthus)、胡萝卜属 (Daucus)、大豆属 (Glycine)、棉属 (Gossypium)、番薯属 (Ipomoea)、莴苣属 (Lactuca)、亚麻属 (Linum)、番茄属 (Lycopersicon)、烟草属 (Nicotiana)、菜豆属 (Phaseolus)、豌豆属 (Pisum)、茄属 (Solanum)、蚕豆属 (Vicia)。

[0948] 以下属的单子叶杂草：山羊草属 (Aegilops)、冰草属 (Agropyron)、剪股颖属 (Agrostis)、看麦娘属 (Alopecurus)、Apera、燕麦属 (Avena)、臂形草属 (Brachiaria)、雀麦属 (Bromus)、蒺藜草属 (Cenchrus)、鸭跖草属 (Commelina)、狗牙根属 (Cynodon)、莎草属 (Cyperus)、龙爪茅属 (Dactyloctenium)、马唐属 (Digitaria)、稗属 (Echinochloa)、荸荠属 (Eleocharis)、蟋蟀草属 (Eleusine)、画眉草属 (Eragrostis)、野黍属 (Eriochloa)、羊茅属 (Festuca)、飘拂草属 (Fimbristylis)、异蕊花属 (Heteranthera)、白茅属 (Imperata)、鸭嘴草属 (Ischaemum)、千金子属 (Leptochloa)、黑麦草属 (Lolium)、雨久花属 (Monochoria)、黍属 (Panicum)、雀稗属 (Paspalum)、藨草属 (Phalaris)、梯牧草属 (Phleum)、早熟禾属 (Poa)、筒轴茅属 (Rottboellia)、慈姑属 (Sagittaria)、莞草属 (Scirpus)、狗尾草属 (Setaria)、高粱属 (Sorghum)。

[0949] 以下属的单子叶作物：葱属 (Allium)、凤梨属 (Ananas)、天门冬属 (Asparagus)、燕麦属 (Avena)、大麦属 (Hordeum)、稻属 (Oryza)、黍属 (Panicum)、甘蔗属 (Saccharum)、黑麦属 (Secale)、高粱属 (Sorghum)、小黑麦属 (Triticale)、小麦属 (Triticum)、玉蜀黍属 (Zea)。

[0950] 然而，本发明活性化合物 / 活性化合物结合物的使用决不限于上述属，而是以相同的方式推广至其它植物。

[0951] 依据浓度，本发明的活性化合物 / 活性化合物结合物适于在例如工业地带和铁道以及有树和无树的道路和场所中用于非选择性防治杂草。同样，本发明的活性化合物也可用于防治多年生作物中的杂草，以及选择性防治一年生作物中的杂草；所述多年生作物包括例如森林、观赏树木栽植、果园、葡萄园、柑桔林、坚果林、香蕉种植园、咖啡种植园、茶叶种植园、橡胶种植园、油椰种植园、可可种植园、浆果种植园和蛇麻草田 (hop field)、草地、草坪和草场。

[0952] 本发明的式 (I) 化合物 / 活性化合物结合物在用于土壤和地上植物部位时，具有很强的除草活性和很宽的活性谱。某种程度上，它们还适于选择性防治单子叶和双子叶作物中的单子叶和双子叶杂草，出苗前和出苗后均可。

[0953] 本发明的活性化合物 / 活性化合物结合物也可以一定浓度或施用率用于防治有害动物以及真菌或细菌植物病害。如果合适,它们还可用作合成其它活性化合物的中间体或前体。

[0954] 本发明的活性化合物 / 活性化合物结合物可转化为常规制剂,例如溶液、乳剂、可湿性粉剂、悬浮剂、粉剂、喷粉剂、膏剂、可溶性粉剂、颗粒、悬乳浓缩剂、用活性化合物浸渍过的天然和合成材料以及聚合物中的极细小的胶囊。

[0955] 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,同时可任选使用表面活性剂,即乳化剂和 / 或分散剂和 / 或发泡剂。

[0956] 若使用的填充剂为水,还可使用例如有机溶剂作为助溶剂。适合的液体溶剂主要有:芳香族化合物,例如二甲苯、甲苯或烷基苯;氯化芳香族化合物和氯化脂族烃,例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,例如环己烷或石蜡,如石油馏分;矿物油和植物油;醇,例如丁醇或乙二醇及其醚和酯;酮,例如丙酮、甲乙酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂,例如二甲基甲酰胺和二甲亚砷;以及水。

[0957] 适合的固体载体为:例如铵盐和粉碎的天然矿物,例如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、凹凸棒石、蒙脱石或硅藻土,以及粉碎的合成矿物,例如研细的二氧化硅、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,以及合成的无机和有机粉颗粒,以及有机物颗粒例如锯木屑、椰壳、玉米穗轴和烟草茎;适合的乳化剂和 / 或发泡剂为: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、芳基磺酸盐和蛋白质水解产物;适合的分散剂包括:例如木素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

[0958] 制剂中可使用增粘剂,例如羧甲基纤维素以及粉末、颗粒或胶乳状的天然和合成聚合物,例如阿拉伯树胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯,以及天然磷脂例如脑磷脂和卵磷脂,和合成磷脂。其它添加剂可以是矿物油和植物油。

[0959] 可使用着色剂,例如无机颜料,如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝,以及有机染料,例如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料,以及微量营养素例如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐。

[0960] 制剂一般包括 0.1 至 95 重量%、优选 0.5 至 90 重量%的活性化合物。

[0961] 本发明的活性化合物 / 活性化合物结合物也可以其本身或其制剂的形式与已知的除草剂和 / 或改善作物植物耐受性的物质(“安全剂”)混合用于杂草防治目的,可事先混合或桶内混合(tank mix)。从而也可与含有一种或多种已知除草剂和安全剂的除草剂产品混合。

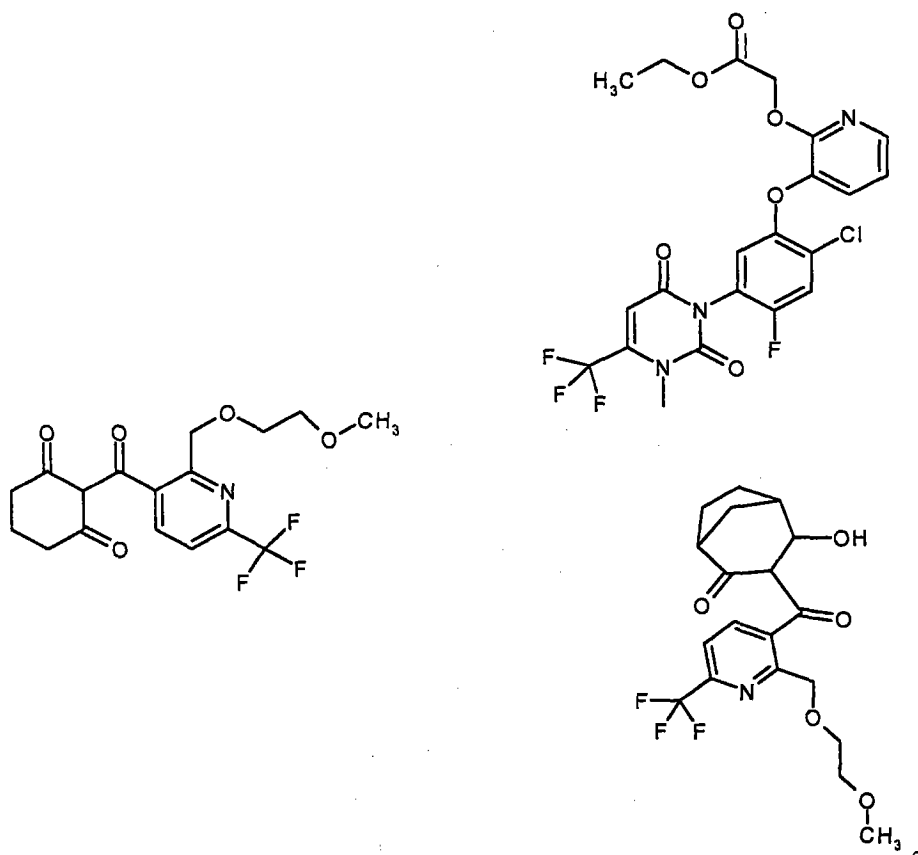
[0962] 适于混合的除草剂为已知除草剂,例如:

[0963] 乙草胺(acetochlor)、三氟羧草醚(acifluorfen(-sodium))、苯草醚(aclonifen)、甲草胺(alachlor)、禾草灭(alloxydim(-sodium))、莠灭净(amestryne)、氨唑草酮(amicarbazone)、先甲草胺(amidochlor)、酰嘧磺隆(amidosulfuron)、氨草啶(aminopyralid)、莎稗磷(anilofos)、磺草灵(asulam)、莠去津(atrazine)、唑啶草酮(azafenidin)、四唑嘧磺隆(azimsulfuron)、氟丁酰草胺(beflubutamid)、草除灵(benazolin(-ethyl))、呋草黄(benfuresate)、苄嘧磺隆(bensulfuron(-methyl))、灭草松(bentazone)、bencarbazone、双苯嘧草酮(benzfendizone)、双环磺草酮

(benzobicyclon)、吡草酮 (benzofenap)、新燕灵 (benzoylprop(-ethyl))、双丙氨膦 (bialaphos)、甲羧除草醚 (bifenox)、双草醚 (bispyribac(-sodium))、溴丁酰草胺 (bromobutide)、溴酚污 (bromofenoxim)、溴苯腈 (bromoxynil)、丁草胺 (butachlor)、氟丙嘧草酯 (butafenacil(-allyl))、丁苯草酮 (butoxydim)、丁草敌 (butylate)、唑草胺 (cafenstrole)、酰肼草 (caloxydim)、双酰草胺 (carbetamide)、唑草酯 (carfentrazone (-ethyl))、甲氧除草醚 (chlomethoxyfen)、草灭畏 (chloramben)、氯草敏 (chloridazon)、氯嘧磺隆 (chlorimuron(-ethyl))、草枯醚 (chlornitrofen)、氯磺隆 (chlorsulfuron)、绿麦隆 (chlortoluron)、吲哚酮草酯 (cinidon(-ethyl))、环庚草醚 (cinmethylin)、醚磺隆 (cinosulfuron)、环苯草酮 (clefoxydim)、烯草酮 (clethodim)、炔草酸 (clodinafop(-propargyl))、异恶草松 (clomazone)、氯甲酰草胺 (clomeprop)、二氯吡啶酸 (clopyralid)、clopyrasulfuron(-methyl)、氯酯磺草胺 (cloransulam(-methyl))、苄草隆、氰草津 (cyanazine)、cybutryne、环草敌 (cycloate)、环丙嘧磺隆 (cyclosulfamuron)、噻草酮 (cycloxydim)、氰氟草酯 (cyhalofop(-butyl))、2,4-D、2,4-DB、甜菜安 (desmedipham)、燕麦敌 (diallate)、麦草畏、精 2,4-滴丙酸 (dichlorprop(-P))、禾草灵 (diclofop(-methyl))、双氯磺草胺 (diclosulam)、乙酰甲草胺 (diethatyl(-ethyl))、野燕枯 (difenzoquat)、吡氟酰草胺 (diflufenican)、氟吡草腈 (diflufenzopyr)、恶唑隆 (dimefuron)、哌草丹、二甲草胺 (dimethachlor)、异戊乙净 (dimethametryn)、二甲吩草胺 (dimethenamid)、dimexyflam、氨基灵 (dinitramine)、双苯酰草胺 (diphenamid)、敌草快 (diquat)、氟硫草定 (dithiopyr)、敌草隆 (diuron)、杀草隆, epropodan、EPTC、戊草丹 (esprocarb)、乙丁烯氟灵 (ethalfluralin)、胺苯磺隆 (ethametsulfuron(-methyl))、乙氧呋草黄 (ethofumesate)、氟乳醚 (ethoxyfen)、乙氧嘧磺隆 (ethoxysulfuron)、乙氧苯草胺 (etobenzanid)、精恶唑禾草灵 (fenoxaprop(-P-ethyl))、四唑酰草胺 (fentrazamide)、麦草氟 (异丙酯、异丙酯-L、甲酯) (flamprop(-isopropyl, -isopropyl-L, -methyl))、啶嘧磺隆 (flazasulfuron)、双氟磺草胺 (florasulam)、精吡氟禾草灵 (fluazifop(-P-butyl))、异丙吡草酯 (fluazolate)、氟酮磺隆 (flucarbazone(-sodium))、氟噻草胺 (flufenacet)、唑嘧磺草胺 (flumetsulam)、氟烯草酸 (flumiclorac(-pentyl))、丙炔氟草胺 (flumioxazin)、flumipropyn、唑嘧磺草胺 (flumetsulam)、氟草隆 (fluometuron)、氟咯草酮 (fluorochloridone)、乙羧氟草醚 (fluoroglycofen (-ethyl))、氟胺草唑 (flupoxam)、flupropacil、flurpysulfuron(-methyl, -sodium)、茚丁酯 (flurenol(-butyl))、氟啶草酮 (fluridone)、氯氟吡氧乙酸 (-丁氧基丙基, -meptyl) (fluroxypyr(-butoxypropyl, -meptyl))、呋嘧醇 (flurprimidol)、呋草酮 (flurtamone)、氟噻乙草酯 (fluthiacet(-methyl))、fluthiamide、氟磺胺草醚 (fomesafen)、甲酰氨磺隆 (foramsulfuron)、草铵膦 (glufosinate(-ammonium))、草甘膦异丙胺盐 (glyphosate(-isopropylammonium))、氟硝磺酰胺 (halosafen)、氟吡禾灵 (吡氟氯禾灵、精吡氟氯禾灵) (haloxyfop(-ethoxyethyl, -P-methyl))、环嗪酮 (hexazinone)、HOK-201、咪草酸 (imazamethabenz(-methyl))、imazamethapyr、氧咪草烟 (imazamox)、imazapic、咪唑烟酸 (imazapyr)、咪唑喹啉酸 (imazaquin)、咪唑乙烟酸 (imazethapyr)、唑吡嘧磺隆 (imazosulfuron)、碘甲磺隆钠盐 (iodosulfuron(-methyl, -sodium))、碘苯腈 (ioxynil)、异丙乐灵 (isopropalin)、异丙隆 (isoproturon)、异恶隆 (isouron)、异恶

酰草胺 (isoxaben)、异恶氯草酮 (isoxachlortole)、异恶唑草酮 (isoxaflutole)、异恶草醚 (isoxapyrifop)、乳氟禾草灵 (lactofen)、环草定 (lenacil)、利谷隆 (linuron)、MCPA、2 甲 4 氯丙酸、苯噻酰草胺 (mefenacet)、甲基二磺隆 (mesosulfurone)、甲基磺草酮 (mesotrione)、恶唑酰草胺 (metamifop)、苯嗪草酮 (metamitron)、吡唑草胺 (metazachlor)、甲基苯噻隆 (methabenzthiazuron)、吡喃隆 (metobenzuron)、溴谷隆 (metobromuron)、 α -异丙甲草胺 ((α -)metolachlor)、磺草唑胺 (metosulam)、甲氧隆 (metoxuron)、嗪草酮 (metribuzin)、甲磺隆 (metsulfuron(-methyl))、禾草敌 (molinate)、绿谷隆 (monolinuron)、萘丙胺 (naproanilide)、敌草胺 (napropamide)、草不隆 (neburon)、烟嘧磺隆 (nicosulfuron)、氟草敏 (norflurazon)、坪草丹 (orbencarb)、噻苯胺磺隆 (orthosulfamuron)、氨磺乐灵 (oryzalin)、丙炔恶草酮 (oxadiargyl)、恶草酮 (oxadiazon)、环氧嘧磺隆 (oxasulfuron)、恶嗪草酮 (oxaziclonefone)、乙氧氟草醚 (oxyfluorfen)、百草枯 (paraquat)、壬酸 (pelargonicacid)、二甲戊灵 (pendimethalin)、pendralin、penoxsulam、环戊恶草酮 (pentoxazone)、甜菜宁 (phenmedipham)、氟吡酰草胺 (picolinafen)、pinoxaden、哌草磷 (piperophos)、丙草胺 (pretilachlor)、氟嘧磺隆 (primisulfuron(-methyl))、氟唑草胺 (proflumizoxon)、扑草净 (prometryn)、毒草胺 (propachlor)、敌稗 (propanil)、恶草酸 (propaquizafop)、异丙草胺 (propisochlor)、propoxycarbazone(-sodium)、炔苯酰草胺 (propyzamide)、苄草丹 (prosulfocarb)、氟磺隆 (prosulfuron)、吡草醚 (pyraflufen(-ethyl))、pyrasulfotole、双唑草腈 (pyrazogyl)、吡唑特 (pyrazolate)、吡嘧磺隆 (pyrazosulfuron(-ethyl))、苄草唑 (pyrazoxyfen)、嘧啶肟草醚 (pyribenzoxim)、稗草丹、吡草特 (pyridate)、pyridatol、环酯草醚 (pyriftalide)、嘧草醚 (pyriminobac(-methyl))、pyrimisulfan、嘧草硫醚 (pyrithiobac(-sodium))、pyroxsulam、pyroxasulfone、二氯喹啉酸 (quinchlorac)、氯甲喹啉酸 (quinmerac)、灭藻醌 (quinoclamine)、喹禾灵 (精喹禾灵、喹禾糖酯) (quizalofop(-P-ethyl, -P-tefuryl))、砒嘧磺隆 (rimsulfuron)、烯禾啉 (sethoxydim)、西玛津 (simazine)、西草净 (simetryn)、磺草酮 (sulcotrione)、甲磺草胺 (sulfentrazone)、甲嘧磺隆 (sulfometuron(-methyl))、草甘膦 (sulfosate)、磺酰磺隆 (sulfosulfuron)、牧草胺 (tebutam)、丁噻隆 (tebuthiuron)、tembotrione、tepraloxymid、特丁津 (terbuthylazine)、特丁净 (terbutryn)、噻吩草胺 (thenylchlor)、thiaflumide、噻唑烟酸 (thiazopyr)、噻二唑草胺 (thidiazimin)、thiencarbazone-methyl、噻吩磺隆 (thifensulfuron(-methyl))、禾草丹 (thiobencarb)、仲草丹 (tiocarbazon)、topramezone、三甲苯草酮 (tralkoxydim)、野燕畏 (triallate)、醚苯磺隆 (triasulfuron)、苯磺隆 (tribenuron(-methyl))、三氯吡氧乙酸 (triclopyr)、灭草环 (tridiphane)、氟乐灵 (trifluralin)、三氟啉磺隆 (trifloxysulfuron)、氟胺磺隆 (triflurosulfuron(-methyl))、三氟甲磺隆 (tritosulfuron) 和

[0964]



[0965] 也可与其它已知活性化合物混合,例如杀菌剂、杀昆虫剂、杀螨虫剂、杀线虫剂、驱鸟剂、植物营养素和土壤结构改良剂。

[0966] 本发明的活性化合物或活性化合物结合物可以其本身、其制剂形式或由其通过进一步稀释制备的使用形式,例如即用的溶液、悬浮剂、乳剂、粉剂、膏剂和颗粒施用。它们以常规方式施用,例如泼浇、喷雾、雾化(atomizing)、抛撒(spreading)。

[0967] 本发明的活性化合物或活性化合物结合物既可在植物出苗前、也可在植物出苗后施用。还可在种植前将其混入土壤中。

[0968] 活性化合物的施用率可在相当宽的范围内变化。这基本上取决于所需药效的性质。一般而言,施用率为每公顷土地面积 1g 至 10kg 的活性化合物,优选每公顷 5g 至 5kg。

[0969] 本发明的活性化合物结合物与作物植物相容性的有利效果在特定的浓度比例下特别显著。但是,活性化合物结合物中的活性化合物的重量比可在相对宽的范围内变化。通常,相对于每重量份的式(I)活性化合物,如上文所述(b')的一种改进作物植物相容性的化合物(解毒剂/安全剂)的盐为 0.001 至 1000 重量份,优选 0.01 至 100 重量份,特别优选 0.05 至 20 重量份。

[0970] 本发明的活性化合物结合物通常以成品制剂形式施用。然而,活性化合物结合物中含有的活性化合物也可作为单独的制剂在使用时混合,即以桶内混合的形式施用。

[0971] 对于特定的施用,尤其是用于出苗后施用方法,还有利的是含有具有植物耐受性的矿物油或植物油(例如市售制剂“Rako Binol”),或者铵盐,如硫酸铵或硫氰酸铵,作为制剂中的其它添加剂。

[0972] 新的活性化合物结合物可以其本身、以其制剂形式或通过进一步稀释而由其制备的使用形式使用,例如即用的溶液、悬浮液、乳液、粉末、膏剂和颗粒剂。施用以常规的方式

进行,例如通过泼浇、喷雾、弥雾、喷粉、撒布。

[0973] 本发明的活性化合物结合物的施用率可在一定的范围内变化;它们尤其取决于天气和土壤因素。通常,施用率为 0.001 至 5kg/ha(公顷),优选为 0.005 至 2kg/ha,特别优选为 0.01 至 0.5kg/ha。

[0974] 本发明的活性化合物结合物可在植物出苗前和出苗后施用,也即出苗前法和出苗后法。

[0975] 根据安全剂的特性,待用于本发明中的安全剂可用于预处理作物植物的种子(拌种),或者可在播种前加入播种沟中,或者在除草剂之前单独使用,或者与除草剂一起使用,植物出苗前或出苗后均可。

[0976] 杀真菌剂可在作物保护中用于防治根肿菌(Plasmodiophoromycete)、卵菌(Oomycete)、壶菌(Chytridiomycete)、接合菌(Zygomycete)、子囊菌(Ascomycete)、担子菌(Basidiomycete)及半知菌(Deuteromycete)。

[0977] 杀细菌剂可在作物保护中用于防治假单胞菌(Pseudomonadaceae)、根瘤菌(Rhizobiaceae)、肠杆菌(Enterobacteriaceae)、棒状杆菌(Corynebacteriaceae)以及链霉菌(Streptomycetaceae)。

[0978] 作为实例但以非限制性的方式可提出以下归入上述属名的一些导致真菌病害和细菌病害的病原体:

[0979] 黄单胞菌属(Xanthomonas)菌种,例如水稻白叶枯病菌(Xanthomonas campestris pv. oryzae);

[0980] 假单胞菌(Pseudomonas)菌种,例如丁香假单胞菌(pseudomonassyringae pv. lachrymans);

[0981] 欧文氏菌属(Erwinia)菌种,例如梨火疫病菌(Erwinia amylovora);

[0982] 腐霉(Pythium)菌种,例如终极腐霉(Pythium ultimum);

[0983] 疫霉(Phytophthora)菌种,例如致病疫霉(Phytophthora infestans);

[0984] 假霜霉(Pseudoperonospora)菌种,例如草假霜霉(Pseudoperonospora humuli)或古巴假霜霉(Pseudoperonosporacubensis);

[0985] 轴霜霉(Plasmopara)菌种,例如葡萄生轴霜霉(Plasmopara viticola);

[0986] 盘霜霉(Bremia)菌种,例如莴苣盘霜霉(Bremia lactucae);

[0987] 霜霉(Peronospora)菌种,例如豌豆霜霉(Peronospora pisi)或十字花科霜霉(P. brassicae);

[0988] 白粉菌(Erysiphe)菌种,例如禾谷白粉菌(Erysiphe graminis);

[0989] 单囊壳属(Sphaerotheca)菌种,例如凤仙花单囊壳(Sphaerotheca fuliginea);

[0990] 叉丝单囊壳属(Podosphaera)菌种,例如白叉丝单囊壳(Podosphaera leucotricha);

[0991] 黑星菌属(Venturia)菌种,例如苹果黑星病菌(Venturia inaequalis);

[0992] 核腔菌属(Pyrenophora)菌种,例如圆核腔菌(Pyrenophora teres)或麦类核腔菌(P. graminea)(分生孢子形式:德氏霉菌(Drechslera), Syn:长蠕孢菌(Helminthosporium));

[0993] 旋孢腔菌属(Cochliobolus)菌种,例如禾旋孢腔菌(Cochliobolus sativus)(分

生孢子形式：德氏霉菌，Syn：长蠕孢菌）；

[0994] 单胞锈菌属 (*Uromyces*) 菌种，例如疣顶单胞锈菌 (*Uromyces appendiculatus*)；

[0995] 柄锈菌 (*Puccinia*) 菌种，例如隐匿柄锈菌 (*Puccinia recondita*)；

[0996] 核盘菌属 (*Sclerotinia*) 菌种，例如油菜菌核病菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*)；

[0997] 腥黑粉菌属 (*Tilletia*) 菌种，例如小麦网腥黑粉菌 (*Tilletia caries*)；

[0998] 黑粉菌 (*Ustilago*) 菌种，例如裸黑粉菌 (*Ustilago nuda*) 或燕麦黑粉菌 (*Ustilago avenae*)；

[0999] 薄膜革菌属 (*Pellicularia*) 菌种，例如佐佐木薄膜革菌 (*Pellicularia sasakii*)；

[1000] 梨孢 (*Pyricularia*) 菌种，例如稻梨孢 (*Pyricularia oryzae*)；

[1001] 镰孢属 (*Fusarium*) 菌种，例如黄色镰孢 (*Fusarium culmorum*)；

[1002] 葡萄孢属 (*Botrytis*) 菌种，例如灰葡萄孢 (*Botrytis cinerea*)；

[1003] 壳针孢属 (*Septoria*) 菌种，例如颖枯壳针孢 (*Septoria nodorum*)；

[1004] 小球腔菌属 (*Leptosphaeria*) 菌种，例如 *Leptosphaeria nodorum*；

[1005] 尾孢属 (*Cercospora*) 菌种，例如变灰尾孢 (*Cercospora poracanesens*)；

[1006] 链格孢属 (*Alternaria*) 菌种，例如芸薹链格孢 (*Alternaria brassicae*)；及

[1007] 假小尾孢属 (*Pseudocercospora*) 菌种，例如小麦基腐病菌 (*Pseudocercospora herpotrichoides*)。

[1008] 本发明的活性化合物还具有极好的植物体内增强作用。因此，它们可用于调动植物的防御系统抵抗不想要的微生物的侵袭。

[1009] 在本发明中，植物增强（抗性诱导）物质的含义应理解为这样一些物质，它们能够刺激植物的防御系统，从而，当经处理的植物之后用不想要的微生物接种时，所述植物表现出对上述微生物显著的抗性。

[1010] 此处，不想要的微生物的含义应理解为植物致病真菌、细菌和病毒。因此，本发明的物质可用于在处理后的某段时间内保护植物抵抗所述病原体的侵袭。在用活性化合物处理植物后，所获得的保护作用的时间通常延续 1 至 10 天，优选 1 至 7 天。

[1011] 本发明的活性化合物在防治植物病害所需浓度下具有良好的植物耐受性，这就使得可对植物的地上部位、离体繁殖株 (propagation stock)、种子以及土壤进行处理。

[1012] 本发明的活性化合物还适于提高农作物的产率。此外，它们还表现出低毒性以及良好的植物耐受性。

[1013] 如果合适，本发明的活性化合物还可以在某个浓度和施用率下用作除草剂，用于调节植物生长，以及用于防治有害动物。如果合适，它们还可用作合成其它活性化合物的中间体和前体。

[1014] 在材料的保护中，本发明物质可用于保护工业材料免受不想要的微生物的侵染及破坏。

[1015] 此处工业材料的含义应理解为已制成的备用于工业中的非活体材料。例如，拟由本发明的活性化合物保护以免受微生物改变或破坏的工业材料可为粘合剂、胶料、纸张及板材、织物、皮革、木材、涂料及塑料制品、冷却润滑剂 (cooling lubricant) 及其它可受微生物侵染或破坏的材料。可能受微生物繁殖损害的生产设备部件，例如冷却水回路，亦可在

待保护材料的范围内。在本发明范围内可提及的工业材料优选为粘合剂、胶料、纸张及板材、皮革、木材、涂料、冷却润滑剂及传热液体,尤其优选木材。

[1016] 可提及的可使工业材料发生降解或改变的微生物为,例如细菌、真菌、酵母菌、藻类及粘液生物(slime organism)。本发明的活性化合物优选作用于真菌,特别是霉菌、木材退色真菌及木腐真菌(担子菌),以及粘液生物及藻类。

[1017] 作为实例可提及以下属的微生物:

[1018] 链格孢属(*Alternaria*),例如链格孢(*Alternaria tenuis*),

[1019] 曲霉属(*Aspergillus*),例如黑曲霉(*Aspergillus niger*),

[1020] 毛壳菌属(*Chaetomium*),例如球毛壳菌(*Chaetomium globosum*),

[1021] 粉革菌属(*Coniophora*),例如粉饱革菌(*Coniophora puetana*),

[1022] 香菇属(*Lentinus*),例如虎皮香菇菌(*Lentinus tigrinus*),

[1023] 青霉属(*Penicillium*),例如灰绿青霉(*Penicillium glaucum*),

[1024] 多孔菌属(*Polyporus*),例如杂色多孔菌(*Polyporus versicolor*),

[1025] 短梗霉属(*Aureobasidium*),例如出芽短梗霉(*Aureobasidium pullulans*),

[1026] 核茎点属(*Sclerophoma*),例如 *Sclerophoma pityophila*,

[1027] 木霉属(*Trichoderma*),例如绿色木霉(*Trichoderma viride*),

[1028] 埃希氏菌属(*Escherichia*),例如大肠埃希氏菌(*Escherichiacoli*),

[1029] 假单胞菌属,例如铜绿假单胞菌(*Pseudomonas aeruginosa*),

[1030] 葡萄球菌属(*Staphylococcus*),例如金黄色葡萄球菌(*Staphylococcus aureus*)。

[1031] 本发明的活性化合物可依据其具体的物理和/或化学性质转化为常规制剂,例如溶液、乳剂、悬浮剂、粉剂、泡沫、膏剂、颗粒剂、气雾剂、聚合物中的微胶囊剂及种子包衣(coating)组合物以及 ULV 冷与热雾制剂。

[1032] 所述制剂以已知方式制备,例如通过将活性化合物与填充剂混合,即与液体溶剂、加压液化气和/或固体载体混合,同时可任选使用表面活性剂,即乳化剂和/或分散剂和/或发泡剂。如果使用的填充剂为水,还可使用例如有机溶剂作为助溶剂。适合的液体溶剂主要有:芳香族化合物,例如二甲苯、甲苯或烷基苯;氯化芳香族化合物或氯化脂族烃,例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,例如环己烷或石蜡,如石油馏分;醇,例如丁醇或乙二醇及它们的醚及酯;酮,例如丙酮、甲乙酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂,例如二甲基甲酰胺和二甲基亚砷;或者水。液化气态填充剂或载体的含义应理解为在标准温度及大气压下为气态的液体,例如气溶胶推进剂,如卤代烃,或丁烷、丙烷、氮气及二氧化碳。适合的固体载体为:例如粉碎的天然矿物,例如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、凹凸棒石、蒙脱石或硅藻土;以及粉碎的合成矿物,例如细分散二氧化硅、氧化铝及硅酸盐。适用于颗粒剂的固体载体为:例如粉碎并分级的天然岩石,如方解石、大理石、浮石、海泡石及白云石;或合成的无机及有机粉颗粒,以及有机物颗粒,如锯木屑、椰壳、玉米穗轴及烟草茎。适合的乳化剂和/或发泡剂为:例如非离子及阴离子乳化剂,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,或蛋白质水解产物。适合的分散剂为:例如木素亚硫酸盐废液及甲基纤维素。

[1033] 制剂中可使用增粘剂,例如羧甲基纤维素;以及粉末、颗粒或胶乳形式的天然及合成聚合物,如阿拉伯树胶、聚乙烯醇及聚乙酸乙烯酯;或天然磷脂,如脑磷脂及卵磷脂;以

及合成磷脂。其它可加入的添加剂为矿物油及植物油。

[1034] 可使用着色剂如无机颜料,例如氧化铁、氧化钛及普鲁士蓝;以及有机着色剂如茜素着色剂、偶氮着色剂及金属酞菁着色剂;以及微量营养素,如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐及锌盐。

[1035] 制剂一般包括 0.1 至 95 重量%的活性化合物,优选 0.5 至 90 重量 %。

[1036] 本发明的活性化合物还可以其本身或其制剂的形式与已知的杀真菌剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂或杀昆虫剂混合使用,以拓宽例如作用谱或防止抗性的产生。在很多情况下,获得了协同效应,即混合物的活性大于各单独组分的活性。

[1037] 合适的混合组分的实例为上述化合物(杀真菌剂、杀细菌剂、杀昆虫剂、杀螨虫剂、杀线虫剂)。

[1038] 还可与其它已知的活性化合物例如除草剂混合,或者与肥料和生长调节剂混合。

[1039] 此外,本发明的式(I)化合物还具有非常好的抗霉菌活性。它们具有非常宽的抗霉菌活性谱,特别是针对皮肤癣菌(dermatophyte)和酵母菌、霉菌和双相真菌(diphaseic fungi)(例如针对念珠菌属(*Candida*)菌种,例如白念珠菌(*Candida albicans*)、光滑念珠菌(*Candida glabrata*)),以及絮状表面癣菌(*Epidermophyton floccosum*),曲霉(*Aspergillus*)菌种,例如黑曲霉(*Aspergillus niger*)和烟曲霉(*Aspergillus fumigatus*),毛癣菌属(*Trichophyton*)菌种,例如须癣毛癣菌(*Trichophyton mentagrophytes*),小孢霉属(*Microsporon*)菌种例如犬小孢霉(*Microsporon canis*)和奥杜盎小孢子菌(*Microsporon audouinii*)。所列真菌仅为解释说明目的,而决非对所涵盖真菌谱的限制。

[1040] 本发明的活性化合物可以其本身、其制剂形式或由其制备的使用形式使用,例如即用的溶液剂、悬浮剂、可湿性粉剂、膏剂、可溶性粉剂、粉末剂和颗粒剂。施用以常规方式进行,例如通过浇灌、喷雾、雾化、撒播、喷粉、发泡、抛撒等。还可通过超低容量法(*ultra-low volume method*)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注入土壤内。还可处理植物种子。

[1041] 当使用本发明的活性化合物作杀菌剂时,施用率可依据施用类型在较宽的范围内变化。对于植物部位的处理,活性化合物施用率一般为 0.1 至 10000g/ha,优选 10 至 1000g/ha。对于拌种,活性化合物施用率一般为 0.001 至 50g 每千克种子,优选 0.01 至 10g 每千克种子。对于土壤处理,活性化合物施用率一般为 0.1 至 10000g/ha,优选 1 至 5000g/ha。

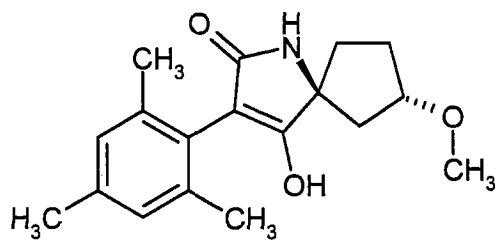
[1042] 术语“活性化合物”包括提及的活性化合物结合物,以及包含铵盐和/或磷盐以及——如果合适——渗透剂的制剂组合物。

[1043] 本发明活性化合物的制备及用途通过以下实施例说明。

[1044] 制备实施例

[1045] 实施例 I-1-a-1

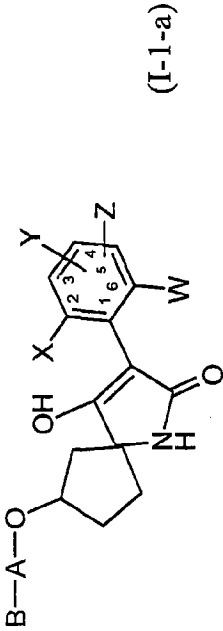
[1046]



[1047] 首先将叔丁醇钾加入 2ml 二甲基乙酰胺中,并加热至 100℃。在该温度下,将 3ml 实施例 II-1 的二甲基乙酰胺溶液分 10 份在 1h 内加入。将该混合物在 100℃下搅拌 2h,然后加入 20ml 水,并使用浓盐酸将 pH 值调节至 1。然后将该混合物浓缩,并溶于 50ml 二氯甲烷中,用硫酸钠干燥并浓缩。通过柱色谱法(梯度为 4 : 1 的正庚烷 / 乙酸乙酯至乙酸乙酯)进行纯化,得到 80mg 目标产物(产率为理论值的 42%),熔点 :209-217℃。

[1048]

以与实施例(I-1-a-1)类似的方式并根据关于制备的总的描述, 获得以下式(I-1-a)的化合物:



实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	熔点(M.p.)°C	异构体
I-1-a-2	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	H	固化泡沫 *2.41 (m, 2H, Ar-CH ₂) 3.23 (s, 3H, OCH ₃) 3.92 (m, 1H, CHOCH ₃)	顺式
I-1-a-3	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	H	油状 *2.41 (m, 2H, Ar-CH ₂) 3.20 (s, 3H, OCH ₃) 4.01 (m, 1H, CHOCH ₃)	反式
I-1-a-4	OCH ₃	C ₂ H ₅	4-Cl	H	CH ₂	H	固化玻璃 *2.45 (m, 2H, Ar-CH ₂) 3.27 (s, 3H, CHOCH ₃) 4.01, 4.06 (2m, Σ 1H, CHOCH ₃)	反式
I-1-a-5	OCH ₃	C ₂ H ₅	4-Cl	H	CH ₂	H	171-178	顺式

[1049]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	熔点(M.p.)°C	异构体
I-1-a-6	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	H	232	顺式
I-1-a-7	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	CH ₃	182-186	顺式
I-1-a-8	OCH ₃	C ₂ H ₅	4-Cl	H	-	H	粘稠油状 *1.00, 1.09 (dt, 3H, Ar-CH ₂ -CH ₃) 4.14, 4.24(2 m, Σ , 1H, CHOH)	顺式
I-1-a-9	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	CH ₃	199-206	顺式
I-1-a-10	CH ₃	CH ₃	4-Br	H	CH ₂	H	242	顺式
I-1-a-11	CH ₃	Cl	4-CH ₃	H	CH ₂	H	243	顺式
I-1-a-12	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₃ H ₇	70-82	顺式
I-1-a-13	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₃ H ₇	180-188	顺式
I-1-a-14	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₃ H ₇	69-76	反式
I-1-a-15	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₃ H ₇	油状 *6.84 ppm (s, 2H, Ar-H), 4.10 ppm (m, 1H, CH-O), 3.37 ppm (t, 2H, CH-OCH ₂),	反式
I-1-a-16	H	CH ₃	5-(4-Cl-Ph)	H	CH ₂	H	231-233	顺式
I-1-a-17	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅	224	顺式

[1050]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	熔点(M.p.)°C	异构体
I-1-a-18	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅	固化泡沫 *6.84 ppm (s, 2H, Ar-H), 4.11 ppm (m, 1H, CH-O), 3.33 ppm (t, 2H, CH-OCH ₂),	反式
I-1-a-19	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅	172-174	顺式
I-1-a-20	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅	固化泡沫 *7.30 以及 7.02 ppm (各自为 s, 1H, Ar-H), 4.10 ppm (m, 1H, CH-O), 3.32 ppm (t, 2H, CH-OCH ₂),	顺式
I-1-a-21	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	$\triangle$	固化泡沫 *4.04 ppm (m, 1H, CH-O), 3.21 ppm (d, 2H, CH-OCH ₂), 2.30 ppm (s, 3H, Ar-CH ₃),	顺式
I-1-a-22	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	$\triangle$	固化泡沫 *4.15 ppm (m, 1H, CH-O), 3.21 ppm (d, 2H, CH-OCH ₂), 2.30 ppm (s, 3H, Ar-CH ₃),	反式

[1051]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	熔点(M.p.)°C	异构体
I-1-a-23	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	$\triangle$ —	217-221	顺式
I-1-a-24	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	$\triangle$ —	固化泡沫 *6.84 ppm (s, 2H, Ar-H), 4.15 ppm (m, 1H, <u>CH-O</u>), 3.22 ppm (d, 2H, <u>CH-OCH₂</u>),	反式
I-1-a-25	H	CH ₃	5-(4-Cl-Ph)	H	CH ₂	$\triangle$ —	211	顺式
I-1-a-26	H	CH ₃	5-(4-Cl-Ph)	H	CH ₂	$\triangle$ —	固化泡沫 *4.33 ppm (m, 1H, <u>CH-O</u>), 3.24 ppm (d, 2H, <u>CH-OCH₂</u>), 2.23 ppm (s, 3H, Ar- <u>CH₃</u>),	反式
I-1-a-27	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -	OCH ₃	固化泡沫 *4.04 ppm (m, 1H, <u>CH-O</u>), 3.27 ppm (s, 3H, <u>OCH₃</u>), 2.29 ppm (s, 3H, Ar- <u>CH₃</u>),	顺式
I-1-a-28	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -	OCH ₃	固化泡沫 *4.15 ppm (m, 1H, <u>CH-O</u>), 3.25 ppm (s, 3H, <u>OCH₃</u>), 2.29 ppm (s, 3H, Ar- <u>CH₃</u>),	反式

[1052]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	熔点(M.p.)°C	异构体
I-1-a-29	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -	OCH ₃	固化泡沫 *6.85 ppm (s, 2H, Ar-H), 4.15 ppm (m, 1H, CH-O), 3.25 ppm (s, 3H, OCH ₃),	反式
I-1-a-30	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -	OCH ₃	固化泡沫 *6.84 ppm (s, 2H, Ar-H), 4.05 ppm (m, 1H, CH-O), 3.27 ppm (s, 3H, OCH ₃),	顺式
I-1-a-31	C ₂ H ₅	Cl	4-Cl	H	CH ₂		固化泡沫 **7.44 以及 7.28 ppm (各自为 s, 1H, Ar-H), 4.04 ppm (m, 1H, CH-O), 0.47 以及 0.18 ppm (各自为 m, 2H, CH-环丙基)	顺式

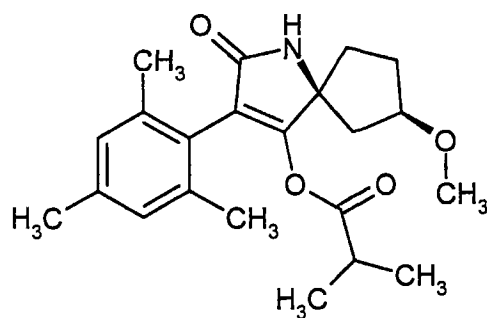
[1053]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	熔点(M.p.)°C	异构体
I-1-a-32	C ₂ H ₅	Cl	4-Cl	H	CH ₂		固化泡沫 **7.44 以及 7.28 ppm (各自 为 s, 1H, Ar-H), 4.14 ppm (m, 1H, CH-O), 0.47 以及 0.18 ppm (各自为 m, 2H, CH-环丙 基),	反式

* ¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): 位移δ的单位为 ppm
** ¹H-NMR (300 MHz, d₆-DMSO): 位移δ的单位为 ppm
Ph = 苯基

[1054] 实施例 I-1-b-1

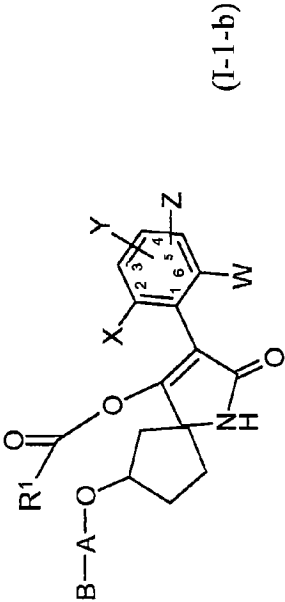
[1055]



[1056] 首先将 0.18g 实施例 I-1-a-6 的化合物加入 8ml 乙酸乙酯中,加入 0.1ml 三乙胺和 1.5mg 4-N,N'-二甲基氨基吡啶,并将混合物加热至 60℃。将 0.07g 异丁酰氯于 2ml 乙酸乙酯中的溶液分 7 份在 60 分钟内加入,并将混合物在 60℃下搅拌 6 小时。将该混合物过夜静置,然后加入半浓缩的 (half-concentrated) 氯化钠溶液,并将有机相分离,通过硅胶柱色谱法 (梯度为 1 : 9 的 EtOAc/ 正庚烷至 100 : 0 的乙酸乙酯 / 正庚烷) 纯化。这得到 85mg 无色固体 (理论产量的 38%)。熔点 :126-134℃

[1057]

以与实施例 (I-1-b-1) 类似的方式并根据关于制备的总的描述, 获得以下式 (I-1-b) 的化合物:



实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	R ¹	熔点 (°C)	异构体
I-1-b-2	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	H	i-C ₃ H ₇	粘稠树脂 *4.00 ppm (m, 1H, CH-OCH ₃), 2.27 ppm (s, 3H, Ar-CH ₃) 1.04 ppm (m, 6H, CH(CH ₃) ₂)	顺式
I-1-b-3	C ₂ H ₅	OCH ₃	4-Cl	H	CH ₂	H	i-C ₃ H ₇	163	顺式
I-1-b-4	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	油状 *7.28 及 7.01 ppm (分别为 s, 1H, Ar-H), 4.07 ppm (m, 1H, CH-OCH ₂), 3.41 ppm (t, 2H, CH-OCH ₂), 1.05 ppm (m, 6H, CH(CH ₃) ₂)	顺式
I-1-b-5	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	76-85	顺式

[1058]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	R ¹	熔点 (°C)	异构体
I-1-b-6	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	$\triangle$	i-C ₃ H ₇	油状 *4.13 ppm (m, 1H, <u>CH</u> -O), 2.29 ppm (s, 3H, Ar-CH ₃), 1.04 ppm (m, 6H, CH(<u>CH</u> ₃) ₂), 0.56 ppm (m, 2H, <u>CH</u> -环丙基)	顺式
I-1-b-7	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	$\triangle$	i-C ₃ H ₇	油状 *4.16 ppm (m, 1H, <u>CH</u> -O), 2.29 ppm (s, 3H, Ar-CH ₃), 1.05 ppm (m, 6H, CH(<u>CH</u> ₃) ₂), 0.52 ppm (m, 2H, <u>CH</u> -环丙基)	反式
I-1-b-8	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	$\triangle$	i-C ₃ H ₇	105	顺式
I-1-b-9	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	$\triangle$	i-C ₃ H ₇	142	反式
I-1-b-10	H	CH ₃	5-(4-Cl-Ph))	H	CH ₂	$\triangle$	i-C ₃ H ₇	136	顺式
I-1-b-11	H	CH ₃	5-(4-Cl-Ph))	H	CH ₂	$\triangle$	i-C ₃ H ₇	154-156	反式

[1059]

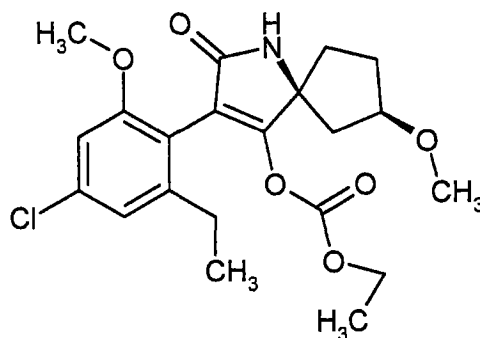
实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	R ¹	熔点 (°C)	异构体
I-1-b-12	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -	OCH ₃	i-C ₃ H ₇	油状 *4.15 ppm (m, 1H, <u>CH-O</u>), 3.43 ppm (d, 3H, OCH ₃), 2.30 ppm (s, 3H, Ar-CH ₃), 1.03 ppm (m, 6H, CH(<u>CH₃</u>) ₂)	顺式
I-1-b-13	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -	OCH ₃	i-C ₃ H ₇	油状 *4.18 ppm (m, 1H, CH-O), 3.37 ppm (d, 3H, OCH ₃), 2.29 ppm (s, 3H, Ar-CH ₃), 1.05 ppm (m, 6H, CH(<u>CH₃</u>) ₂)	反式
I-1-b-14	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -	OCH ₃	i-C ₃ H ₇	蜡状 *6.82 ppm (s, 2H, Ar-H), 4.15 ppm (m, 1H, CH-O), 3.42 ppm (d, 3H, OCH ₃), 1.00 ppm (m, 6H, CH(<u>CH₃</u>) ₂)	顺式
I-1-b-15	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -	OCH ₃	i-C ₃ H ₇	蜡状 *6.84 ppm (s, 2H, Ar-H), 4.17 ppm (m, 1H, CH-O), 3.37 ppm (d, 3H, OCH ₃), 1.01 ppm (m, 6H, CH(<u>CH₃</u>) ₂)	反式

[1060]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	R ¹	熔点 (°C)	异构体
I-1-b-16	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -	OCH ₃	2-Cl-Ph	127-147	顺式

* ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): 位移δ的单位是 ppm
Ph = 苯基

[1061] 实施例 I-1-c-1
[1062]

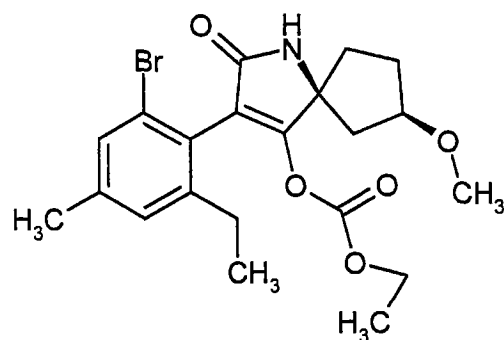


[1063] 将 0.077g 实施例 I-1-a-5 (0.219mmol) 溶解于 3ml 二氯甲烷中, 加入 0.04ml 三乙胺 (1.2 当量), 并将混合物在室温下搅拌 10 分钟。然后加入 0.02ml 氯甲酸乙酯 (1.1 当量), 并将混合物在室温下搅拌过夜。用浓度 4% 的 Na_2CO_3 溶液萃取后, 将有机相干燥、浓缩并通过硅胶柱色谱法 (梯度为 9 : 1 的正庚烷 / 乙酸乙酯至乙酸乙酯) 纯化。这样生成 44mg 固化玻璃状的产物 (产率 : 理论值的 47%)。

[1064] $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ = 3.32 (s, 3H, CH-OCH_3), 3.76 (s, 3H, Ar-OCH_3), 4.05 (q, 2H, OCH_2) ppm。

[1065] 实施例 (I-1-c-2) 以与实施例 (I-1-c-1) 相似的方式获得。

[1066]



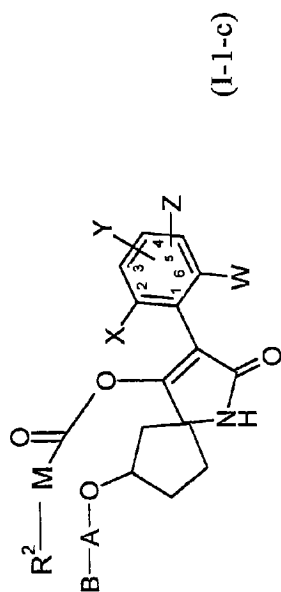
(I-1-c-2)

[1067] $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ = 3.32 (s, 3H, CH-OCH_3), 2.58 (m, 2H, Ar-CH_2), 4.07 (q, 2H, OCH_2) ppm。

[1068]

以及实施例(I-1-c-1)、(I-1-c-2)类似的方式并根据关于制备的总的描述,获得以下式(I-1-c)的化合物

物



实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	M	R ¹	熔点 (°C)	异构体
I-1-c-3	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	H	O	C ₂ H ₅	114-117	顺式
I-1-c-4	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	H	O	C ₂ H ₅	174-178	反式
I-1-c-5	CH ₃	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	H	O	C ₂ H ₅	油状 *7.24 及 6.99 ppm (各自为 s, 1H, Ar-H), 4.07 ppm (q, 2H, <u>CH</u> ₂ -O), 4.00 ppm (m, 1H, <u>CH</u> -OCH ₃)	顺式
I-1-c-6	CH ₃	Cl	4-CH ₃	H	CH ₂	H	O	C ₂ H ₅	119-123	顺式
I-1-c-7	C ₂ H ₅	CH ₃	4-Br	H	CH ₂	C ₃ H ₇	O	C ₂ H ₅	油状 *7.24 及 7.01 ppm (各自为 s, 1H, Ar-H), 4.07 ppm (m, 3H, <u>CH</u> ₂ -O 及 <u>CH</u> -OCH ₂), 3.41 ppm (t, 2H, <u>CH</u> -OCH ₂)	顺式

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	M	R ¹	熔点 (°C)	异构体
I-1-c-8	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₃ H ₇	O	C ₂ H ₅	油状 *6.86 ppm (s, 2H, Ar-H), 4.08 ppm (m, 1H, CH-O), 4.01 ppm (q, 2H, CH ₂ -O), 3.42 ppm (t, 2H, CH-OCH ₂)	顺式
I-1-c-9	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₃ H ₇	O	C ₂ H ₅	油状 *7.24 及 7.01 ppm (各自为 s, 1H, Ar-H), 4.10 ppm (m, 3H, CH ₂ -O 及 CH-OCH ₂) 3.37 ppm (t, 2H, CH-OCH ₂)	反式
I-1-c-10	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₃ H ₇	O	C ₂ H ₅	126-129	反式
I-1-c-11	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	CH ₃	O	C ₂ H ₅	94-96	顺式
I-1-c-12	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	CH ₃	O	C ₂ H ₅	油状 *7.28 及 7.01 ppm (各自为 s, 1H, Ar-H), 4.13 ppm (m, 1H, CH-OCH ₂), 4.07 (q, 2H, CH ₂ -O), 3.45 ppm (t, 2H, CH-OCH ₂)	反式
I-1-c-13	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	CH ₃	O	C ₂ H ₅	油状 *6.87 ppm (s, 2H, Ar-H), 4.13 ppm (m, 1H, CH-O), 4.01 ppm (q, 2H, CH ₂ -O), 3.47 ppm (t, 2H, CH-OCH ₂)	顺式
I-1-c-14	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	CH ₃	O	C ₂ H ₅	120-125	反式

[1070]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	M	R ¹	熔点 (°C)	异构体
I-1-c-15	H	CH ₃	5-(4-Cl-Ph)	H	CH ₂	H	O	C ₂ H ₅	粘稠油状 *4.03 ppm (m, 3H, <u>CH-OCH₃</u> , <u>CH₂-O</u>), 2.32 (s, 3H, Ar- <u>CH₃</u>)	顺式
I-1-c-16	H	CH ₃	5-(4-Cl-Ph)	H	CH ₂	H	O	C ₂ H ₅	167-171	反式
I-1-c-17	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅	O	C ₂ H ₅	油状 *6.87 ppm (s, 2H, Ar- <u>H</u>), 4.08 ppm (m, 1H, <u>CH-O</u>), 4.01 ppm (q, 2H, <u>CH₂-O</u>), 3.37 ppm (t, 2H, <u>CH-OCH₂</u>)	顺式
I-1-c-18	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅	O	C ₂ H ₅	102-105	顺式
I-1-c-19	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅	O	C ₂ H ₅	110-113	反式
I-1-c-20	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅	O	C ₂ H ₅	油状 *7.24 及 7.01 ppm (各自为 s, 1H, Ar- <u>H</u>), 4.08 ppm (m, 3H, <u>CH-O</u> 及 <u>CH₂-O</u>), 3.37 ppm (t, 2H, <u>CH-OCH₂</u>)	反式
I-1-c-21	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	$\triangle$	O	C ₂ H ₅	127-129	顺式
I-1-c-22	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	$\triangle$	O	C ₂ H ₅	113	顺式
I-1-c-23	H	CH ₃	5-(4-Cl-Ph)	H	CH ₂	$\triangle$	O	C ₂ H ₅	固化泡沫 *4.15 ppm (m, 1H, <u>CH-O</u>), 4.01 ppm (q, 2H, <u>CH₂-O</u>), 3.27 ppm (d, 2H, <u>CH-OCH₂</u>), 2.34 ppm (s, 3H, Ar- <u>CH₃</u>)	顺式

[1071]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	M	R ¹	熔点 (°C)	异构体
I-1-c-24	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	$\triangle$	O	C ₂ H ₅	油状 *4.15 ppm (m, 1H, <u>CH</u> -O), 4.05 ppm (q, 2H, <u>CH</u> ₂ -O), 3.23 ppm (d, 2H, <u>CH</u> -O <u>CH</u> ₂), 2.30 ppm (s, 3H, Ar- <u>CH</u> ₃)	反式
I-1-c-25	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	$\triangle$	O	C ₂ H ₅	固化泡沫 *6.86 ppm (s, 2H, Ar- <u>H</u>), 4.15 ppm (m, 1H, <u>CH</u> -O), 4.03 ppm (q, 2H, <u>CH</u> ₂ -O), 3.23 ppm (d, 2H, <u>CH</u> -O <u>CH</u> ₂)	反式
I-1-c-26	H	CH ₃	5-(4-Cl-Ph)	H	CH ₂	$\triangle$	O	C ₂ H ₅	固化泡沫 *4.18 ppm (m, 1H, <u>CH</u> -O), 4.01 ppm (q, 2H, <u>CH</u> ₂ -O), 3.23 ppm (d, 2H, <u>CH</u> -O <u>CH</u> ₂), 2.31 ppm (s, 3H, Ar- <u>CH</u> ₃)	反式
I-1-c-27	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -	OCH ₃	O	C ₂ H ₅	油状 *4.16 ppm (m, 1H, <u>CH</u> -O), 4.05 ppm (q, 2H, <u>CH</u> ₂ -O), 3.42 ppm (s, 3H, O <u>CH</u> ₃), 2.30 ppm (s, 3H, Ar- <u>CH</u> ₃)	顺式
I-1-c-28	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -	OCH ₃	O	C ₂ H ₅	油状 *4.18 ppm (m, 1H, <u>CH</u> -O), 4.05 ppm (q, 2H, <u>CH</u> ₂ -O), 3.38 ppm (s, 3H, O <u>CH</u> ₃), 2.30 ppm (s, 3H, Ar- <u>CH</u> ₃)	反式

[1072]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	M	R ¹	熔点 (°C)	异构体
I-1-c-29	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -	OCH ₃	O	C ₂ H ₅	固化泡沫 *6.85 ppm (s, 2H, Ar-H), 4.15 ppm (m, 1H, CH-O), 4.01 ppm (q, 2H, CH ₂ -O), 3.42 ppm (s, 3H, OCH ₃)	顺式
I-1-c-30	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -	OCH ₃	O	C ₂ H ₅	油状 *6.86 ppm (s, 2H, Ar-H), 4.17 ppm (m, 1H, CH-O), 4.01 ppm (q, 2H, CH ₂ -O), 3.37 ppm (s, 3H, CH-O-CH ₃)	反式
I-1-c-31	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -	OCH ₃	O	CH ₂ =CH-C H ₂	油状 *4.48 ppm (d, 2H, CH ₂ =CH-CH ₂ O), 4.16 ppm (m, 1H, CH-O), 3.42 ppm (d, 3H, OCH ₃), 2.30 ppm (s, 3H, Ar-CH ₃) ₂	顺式
I-1-c-32	C ₂ H ₅	Cl	4-Cl	H	CH ₂	△	O	C ₂ H ₅	油状 *7.29 及 7.18 ppm (各自为 s, 1H, Ar-H), 4.15 ppm (m, 1H, CH-O), 4.07 ppm (q, 2H, C(=O)OCH ₂), 1.04 ppm (m, 1H, CH-环丙基)	顺式

[1073]

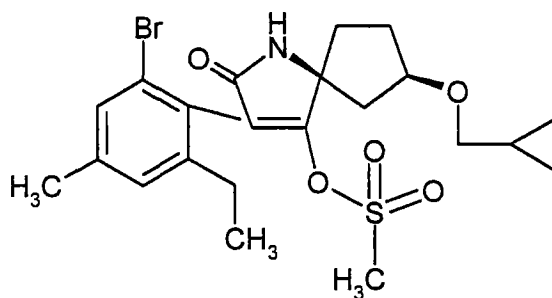
实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	M	R ¹	， 熔点 (°C)	异构体
I-1-c-33	C ₂ H ₅	Cl	4-Cl	H	CH ₂	△—	O	C ₂ H ₅	油状 *7.29 及 7.18 ppm (各自为 s, 1H, Ar-H), 4.17 ppm (m, 1H, CH-O), 4.08 ppm (q, 2H, C(=O)OCH ₂), 1.04 ppm (m, 1H, CH-环丙基)	反式

* ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): 位移δ的单位为 ppm

** ¹H-NMR (300 MHz, CDCl₃): 位移δ的单位为 ppm

Ph = 苯基

[1074] 实施例 I-1-d-1
[1075]



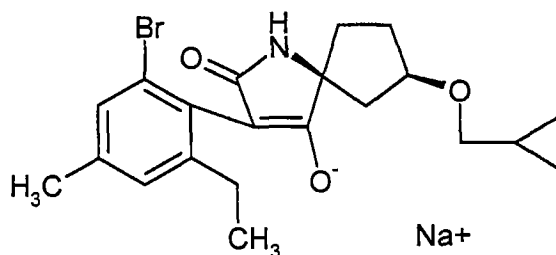
[1076] 将 0.156g 实施例 I-1-a-21 化合物溶解于 10ml 二氯甲烷中, 并加入 0.06ml 三乙胺。向该溶液中加入 0.032ml 甲磺酰氯, 并将该混合物于室温下搅拌 20h。然后将该混合物与 5ml 浓度 5% 的碳酸氢钠溶液一起搅拌 0.5h, 将有机溶液分离、用硫酸钠干燥并使用旋转蒸发器浓缩, 将所得的剩余物通过柱色谱法 (梯度为正庚烷 + 乙酸乙酯 9 : 1 至乙酸乙酯) 纯化。

[1077] 产率 : 0.14g (理论值的 76%)

[1078] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : δ = 4.16ppm (m, 1H, CH-O), 2.62ppm (s, 3H, SO_2CH_3), 2.32ppm (s, 3H, Ar-CH_3), 1.03ppm (m, 1H, CH-环丙基)。

[1079] 实施例 I-1-f-1

[1080]



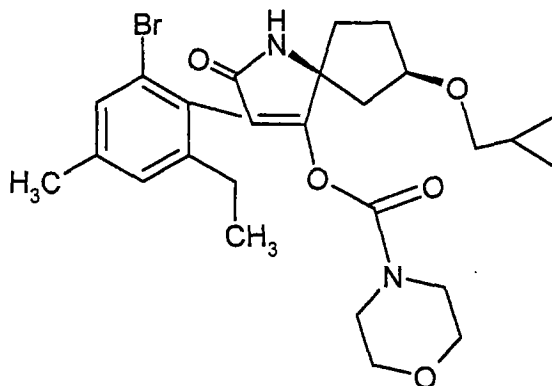
[1081] 将 0.1g 实施例 I-1-a-21 化合物溶解于 7ml 无水甲醇中, 并加入 0.045ml 浓度 30% 的甲醇钠溶液。2h 后, 使用旋转蒸发器浓缩该溶液, 并再分别用 5ml 无水甲醇在旋转蒸发器中浓缩 2 次, 在高真空下干燥。

[1082] 产率 : 0.095g (理论值的 90%)

[1083] $^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$, 400MHz) : δ = 5.01ppm (m, 1H, CH-O), 2.21ppm (s, 3H, Ar-CH_3), 0.45 及 0.16ppm (各自为 m, 2H, CH-环丙基)。

[1084] 实施例 I-1-g-1

[1085]



[1086] 将 0.158g 实施例 I-1-a-21 化合物溶解于 10ml 氯仿中, 并加入 0.08ml 二异丙基

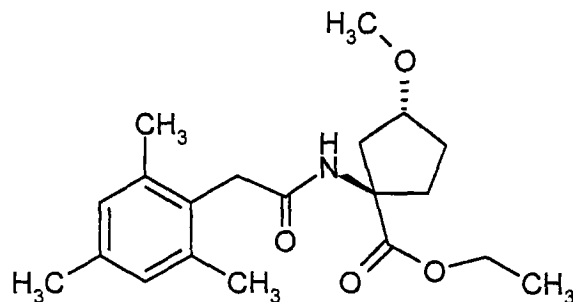
乙胺和 2mg DMAP。加入 0.048ml 吗啉-N-羰酰氯,并将溶液在室温下搅拌 20h。然后将该混合物与 5ml 浓度 5% 的碳酸氢钠溶液一起搅拌 0.5h,将有机溶液分离、用硫酸钠干燥并使用旋转蒸发器浓缩,所得的剩余物通过柱色谱法(梯度为正庚烷+乙酸乙酯 9:1 至乙酸乙酯)纯化。

[1087] 产率:0.14g(理论值的 63%)

[1088] $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: $\delta = 4.14\text{ppm}(\text{m}, 1\text{H}, \text{CH-O})$, $3.6-3.1\text{ppm}$ (多个多重峰, 10H , CH_2O 和 CH_2N 信号), $2.32\text{ppm}(\text{s}, 3\text{H}, \text{Ar-CH}_3)$ 。

[1089] 实施例 II-1

[1090]

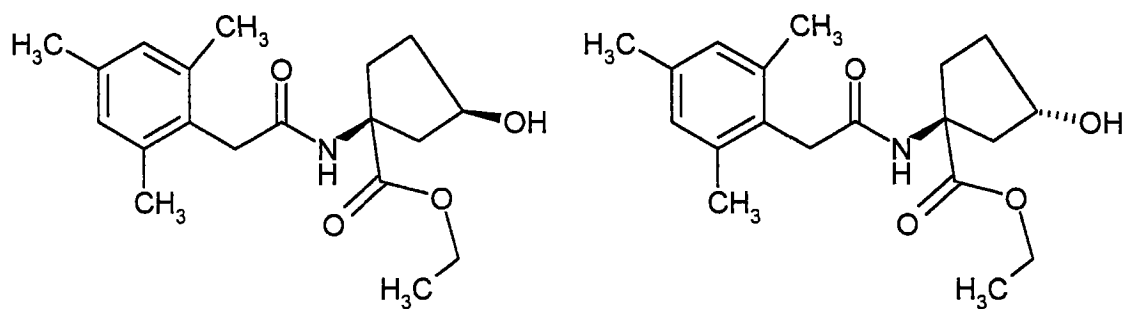


[1091] 将 0.41g 实施例 II-10 (1.23mmol) 溶解于 15ml 二氯甲烷中。加入 0.29g 1,8-双二甲基氨基萘 (1.1 当量) 和 0.20g 三甲基氧鎓四氟硼酸盐 (1.1 当量),并将该混合物于室温下搅拌。然后,4 小时后,分别一次加入各 0.3 当量的三甲基氧鎓四氟硼酸盐和 1,8-双二甲基氨基萘,再将该混合物搅拌过夜。然后加入 20ml 浓度 5% 的柠檬酸,将该混合物搅拌 45 分钟,并将有机相分离、用硫酸钠干燥并用硅胶柱色谱法(梯度为 4:1 正庚烷/乙酸乙酯至乙酸乙酯)纯化。

[1092] 这得到 0.27g 产物(理论产量的 63%)。

[1093] $^1\text{H-NMR}(400\text{MHz}, \text{CDCl}_3)$ $\delta = 4.16(\text{q}, 2\text{H}, \text{CH-OCH}_2)$, $3.93(\text{m}, 1\text{H}, \text{CH-OCH}_3)$, $3.56(\text{s}, 2\text{H}, \text{CH}_2\text{-Ar})$, $3.26(\text{s}, 3\text{H}, \text{OCH}_3)$ ppm。

[1094]



[1095] 实施例 II-9 实施例 II-10

[1096] 回流条件下,将 1.05g 均三甲苯乙酸 (5.89mmol)、6ml 亚硫酸氯和两滴 N,N-二甲基甲酰胺加热至沸腾。停止产生气体后,将该混合物浓缩并溶于 20ml 二氯甲烷中(溶液 1)。将 1.25g 三乙胺 (2.1 当量) 加入 3-羟基-1-氨基环戊羧酸乙酯 (5.89mmol) 溶液中,并将该混合物搅拌 10 分钟。室温下,20 分钟内逐滴加入溶液 1。将该混合物在室温下搅拌过夜。将该混合物用 15ml 水洗涤,有机相用硫酸钠干燥并通过硅胶柱色谱法(梯度为乙酸乙酯/正庚烷从 0:100 至 100:00)纯化。这样得到 0.95g 顺式异构体(产率为理论值

的 48%), 以及 0.43g 反式异构体 (产率为理论值的 22%) 。

[1097] 反式异构体实施例 II-10

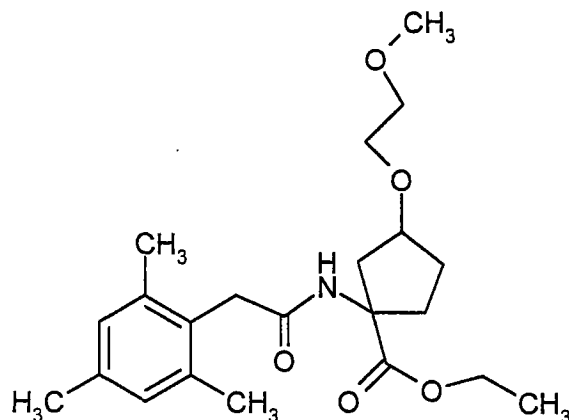
[1098] $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ = 4.38 (m, 1H, CHOH), 3.53 (s, 2H, Ar-CH_2) ppm

[1099] 顺式异构体实施例 II-9

[1100] $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ = 4.21 ppm (m, 1H, CHOH), 3.60 (s, 2H, Ar-CH_2) ppm

[1101] 实施例 II-34

[1102]



[1103] 最初投入 1.87g 均三甲苯乙酸和 6.25g 亚硫酸氯, 并加入 2 滴二甲基甲酰胺。然后将该混合物加热直至气体逸出停止、浓缩混合物并溶解在 25ml 二氯甲烷中 (溶液 1)。将 2.49 实施例 (XIV-2) 化合物溶于 25ml 二氯甲烷中, 并加入 3.06ml 三乙胺, 然后在 30 分钟内逐滴加入溶液 1, 并将该混合物在室温下搅拌过夜。加入半浓缩的氯化钠溶液, 分离各相, 并且将有机相浓缩、用硫酸钠干燥并通过柱色谱法 (梯度为从 5 : 95 乙酸乙酯 / 庚烷至 70 : 30 乙酸乙酯) 纯化。

[1104] 产率 : 1.91g (理论值的 38%)。

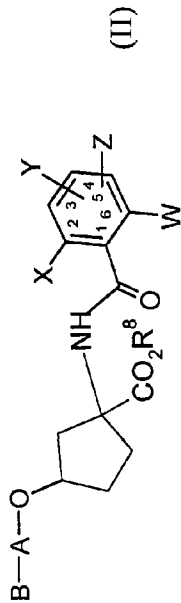
[1105] $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ = 6.89ppm (d, 1H, Ar-H)

[1106] 3.35ppm (d, 3H, OCH_3)

[1107] 1.24ppm (t, 3H, $\text{CH}_3\text{-CH}_2\text{O}$)

[1108]

以类似于实施例 (II-1)、(II-9)、(II-10) 和 (II-34) 的方式并根据关于制备的总的描述, 获得以下式 (II) 化合物:



实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	R ⁸	熔点 °C	异构体
II-2	OCH ₃	C ₂ H ₅	4-Cl	H	CH ₂	H	C ₂ H ₅	油状 *3.07 (s, 3H, <u>CHOCH₃</u>) 3.55 (s, 2H, <u>ArCH₂-CO</u>) 3.84 (m, 1H, <u>CH-OCH₃</u>) 及 s, 3H, <u>Ar-OCH₃</u>) 4.13 (q, 2H, <u>O-CH₂-CH₃</u>)	顺式
II-3	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	H	C ₂ H ₅	油状 *3.01 (s, 3H, <u>CH-OCH₃</u>) 3.52 (s, 2H, <u>Ar-CH₂-CO</u>) 3.81 (m, 1H, <u>CH-OCH₃</u>) 4.16 (q, 2H, <u>O-CH₂-CH₃</u>)	顺式

[1109]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	R ⁸	熔点°C	异构体
II-4	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	H	C ₂ H ₅	油状 *3.05 (m, 3H, <u>CHOCH₃</u>) 3.76 (s, 2H, Ar-CH ₂ -CO) 3.84, (m, 1H, <u>CHOCH₃</u>) 4.16 (q, 2H, O- <u>CH₂</u> -CH ₃)	顺式
II-5	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	H	C ₂ H ₅	油状 *3.29 (s, 3H, CH-O <u>CH₃</u>) 3.75 (s, 2H, Ar-CH ₂ -CO) 4.03, (m, 1H, CH-O <u>CH₃</u>) 4.16 (q, 1H, O- <u>CH₂</u> -CH ₃)	反式
II-6	OCH ₃	C ₂ H ₅	4-Cl	H	CH ₂	H	C ₂ H ₅	油状 未经进一步表征转化成实施 例 I-1-a-4	反式
II-7	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	油状 *3.29 (m, 2H, CH-O <u>CH₂</u> -CH ₃) 3.76 (s, 2H, Ar-CH ₂ -CO) 3.95, (m, 1H, <u>CH-O-CH₂</u> CH ₃) 4.15 (q, 2H, O- <u>CH₂</u> -CH ₃)	顺式

[1110]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	R ⁸	熔点°C	异构体
II-8	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	油状 *3.43 (m, 2H, CH-OCH ₂ -CH ₃) 3.75 (s, 2H, Ar-CH ₂ -CO) 4.14 (m, 2H + 1H, CH-OCH ₂ CH ₃ 及 O-CH ₂ -CH ₃)	反式
II-9	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	-	H	C ₂ H ₅	见方法	顺式
II-10	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	-	H	C ₂ H ₅	见方法	反式
II-11	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	-	H	C ₂ H ₅	油状 *3.80 (s, 2H, Ar-CH ₂ -CO) 4.36 (m, 1H CH-OH)	顺式
II-12	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	-	H	C ₂ H ₅	油状 *3.76 (s, 2H, Ar-CH ₂ CO) 4.43 (m, 1H CH-OH)	反式
II-13	OCH ₃	C ₂ H ₅	4-Cl	H	-	H	C ₂ H ₅	油状 *3.60 (s, 2H, Ar-CH ₂ -CO) 4.34 (m, 1H CH-OH)	顺式
II-14	OCH ₃	C ₂ H ₅	4-Cl	H	-	H	C ₂ H ₅	油状 *3.55 (s, 2H, Ar-CH ₂ -CO) 4.43 (m, 1H CHOH)	反式

[1111]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	R ⁸	熔点/°C	异构体
II-15	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	油状 *6.86 ppm (各自为 s, 1H, Ar-H), 1.25 及 0.99 ppm (各自 为 t, 3H, <u>CH₃-CH₂O</u>)	顺式
II-16	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	油状 *6.86 ppm (各自为 s, 1H, Ar-H), 1.24 及 1.15 ppm (各自 为 t, 3H, <u>CH₃-CH₂O</u>)	反式
II-17	CH ₃	Br	4-CH ₃	H	-	H	C ₂ H ₅	油状 *7.28 及 6.99 ppm (各自为 s, 1H, Ar-H), 4.36 ppm (m, 1H, <u>CH-O</u>), 4.15 ppm (m, 2H, <u>CH₂-O</u>)	顺式
II-18	CH ₃	Br	4-CH ₃	H	-	H	C ₂ H ₅	油状 *7.28 及 6.99 ppm (各自为 s, 1H, Ar-H), 4.44 ppm (m, 1H, <u>CH-O</u>), 4.16 ppm (m, 2H, <u>CH₂-O</u>)	反式

[1112]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	R ⁸	熔点 °C	异构体
II-19	CH ₃	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	H	C ₂ H ₅	油状 *7.24 及 6.99 ppm (各自为 s, 1H, Ar-H), 4.16 ppm (m, 2H, CH ₂ -O), 3.84 ppm (m, 1H, CH-OCH ₃)	顺式
II-20	CH ₃	Cl	4-CH ₃	H	-	H	C ₂ H ₅	油状 *7.13 及 6.96 ppm (各自为 s, 1H, Ar-H), 4.35 ppm (m, 1H, CH-O), 4.16 ppm (m, 2H, CH ₂ -O)	顺式
II-21	CH ₃	Cl	4-CH ₃	H	-	H	C ₂ H ₅	固化泡沫 *7.13 及 6.96 ppm (各自为 s, 1H, Ar-H), 4.45 ppm (m, 1H, CH ₂ -O), 4.16 ppm (m, 2H, CH ₂ -O)	反式
II-22	CH ₃	Cl	4-CH ₃	H	CH ₂	H	C ₂ H ₅	95-99	顺式

[1113]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	R ⁸	熔点/°C	异构体
II-23	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	油状 *6.91 及 6.88 ppm (各自为 s, 总体为 2H, Ar-H), 4.16 ppm (m, 2H, CH ₂ -O), 4.00 及 3.92 ppm (各自为 m, 总体为 1H, CH-O)	混合物 顺式/反式
II-24	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	油状 *7.30 及 7.27 ppm (各自为 s, 总体为 1H, Ar-H), 7.00 及 6.99 ppm (各自为 s, 总体为 1H, AR-H), 4.16 ppm (m, 2H, CH ₂ -O), 4.08 及 3.95 ppm (各 自为 m, 总体为 1H, CH-O)	混合物 顺式/反式
II-25	H	CH ₃	5-(4-Cl-Ph)	H	-	H	C ₂ H ₅	固化泡沫 **4.43 ppm (m, 1H, CH-CO) 4.16 (m, 2H CH ₂ -O), 2.34 (s, 3H, Ar-CH ₃)	反式

[1114]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	R ⁸	熔点/°C	异构体
II-26	H	CH ₃	5-(4-Cl-Ph)	H	-	H	C ₂ H ₅	固化泡沫 **4.37 ppm (m, 1H, <u>CH</u> -CO) 4.16 (m, 2H <u>CH</u> ₂ -O), 2.34 (s, 3H, Ar- <u>CH</u> ₃)	顺式
II-27	H	CH ₃	5-(4-Cl-Ph)	H	CH ₂	H	C ₂ H ₅	固化泡沫 **4.16 (m, 2H, <u>CH</u> ₂ -O) 4.03 ppm (m, 1H <u>CH</u> -O), 2.36 (s, 3H, Ar- <u>CH</u> ₃)	反式
II-28	H	CH ₃	5-(4-Cl-Ph)	H	CH ₂	H	C ₂ H ₅	油状 **4.16 (m, 2H, <u>CH</u> ₂ -O) 3.82 ppm (m, 1H <u>CH</u> -O), 2.37 (s, 3H, Ar- <u>CH</u> ₃)	顺式
II-29	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	油状 *6.91 及 6.88 ppm (各自为 s, 总体为 2H, Ar- <u>H</u>), 4.16 ppm (m, 2H, <u>CH</u> ₂ -O), 4.01 及 3.90 ppm (各自为 m, 总体为 1H, <u>CH</u> -O)	混合物 顺式/反式

[1115]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	R ⁸	熔点 °C	异构体
II-30	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	油状 *7.30 及 7.27 ppm (各自为 s, 总体为 1H, Ar-H), 7.00 及 6.99 ppm (各自为 s, 总体为 1H, AR-H), 4.16 ppm (m, 2H, CH ₂ -O), 4.09 及 3.93 ppm (各自为 m, 总体为 1H, CH-O)	混合物 顺式/反式
II-31	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₂		C ₂ H ₅	油状 *6.88 ppm (d, 1H, Ar-H), 1.25 ppm (t, 3H, CH ₃ -CH ₂ O), 0.51 ppm (m, 2H, CH (环丙基))	混合物 顺式/反式
II-32	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	CH ₂		C ₂ H ₅	油状 *2.30 ppm (d, 2H, Ar-CH ₃), 1.25 ppm (m, 6H, CH ₃ -CH ₂ O) 及 Ar-CH ₂ -CH ₃ , 0.49 ppm (m, 2H, CH (环丙基))	混合物 顺式/反式

[1116]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	R ⁸	熔点/°C	异构体
II-33	H	CH ₃	5-(4-Cl-Ph)	H	CH ₂	$\triangle$	C ₂ H ₅	油状 *2.35 ppm (d, 2H, Ar-CH ₃), 1.25 ppm (m, 3H, CH ₃ -CH ₂ O) 0.50 及 0.40 ppm (各自为 m, 总体为 2H CH (环丙基))	混合物 顺式/反式
II-34	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -	OCH ₃	C ₂ H ₅	油状 *6.89 ppm (d, 1H, Ar-H), 3.35 ppm (d, 3H, OCH ₃), 1.24 ppm (t, 3H, CH ₃ -CH ₂ O)	混合物 顺式/反式
II-35	C ₂ H ₅	Br	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -	OCH ₃	C ₂ H ₅	油状 **3.37 ppm (s, 3H, OCH ₃), 2.30 ppm (d, 3H, Ar-CH ₃), 1.24 ppm (m, 6H, CH ₃ -CH ₂ O 及 Ar-CH ₂ CH ₃)	混合物 顺式/反式
II-36	CH ₃	CH ₃	4-Br	H	-	H	C ₂ H ₅	蜡状 *4.41 ppm (m, 1H, CH-OH), 4.18 ppm (m, 2H, CH ₂ -O), 3.52 (s, 2H, Ar-CH ₂)	反式

[1117]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	R ⁸	熔点°C	异构体
II-37	CH ₃	CH ₃	4-Br	H	-	H	C ₂ H ₅	蜡状 *4.37 ppm (m, 1H, CH-OH), 4.15 ppm (m, 2H, CH ₂ -O)	顺式

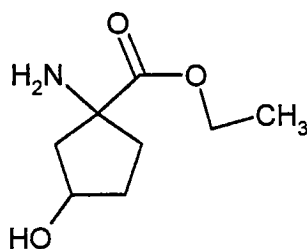
* 1H-NMR (400 MHz, CDCl₃): 位移δ的单位为 ppm

** 1H-NMR (300 MHz, CDCl₃): 位移δ的单位为 ppm

Ph = 苯基

[1118] 3-羟基-1-氨基-1-环戊羧酸乙酯

[1119]



[1120] 以与 WO 02/46128 类似的方式

[1121] 将 9.188g 氢化钠 (60%, 2.2 当量) 悬浮于 400ml 无水四氢呋喃中, 并在 30 分钟内逐滴加入 27.914g N-二苯基亚甲基氨基乙酸乙酯 (1 当量) 的 100ml 四氢呋喃溶液。将该混合物搅拌 30 分钟, 然后, 在 30 分钟内逐滴加入溶于 100ml 四氢呋喃的二溴化物 A*。先将该混合物回流下搅拌 4h, 然后在室温下搅拌过夜。

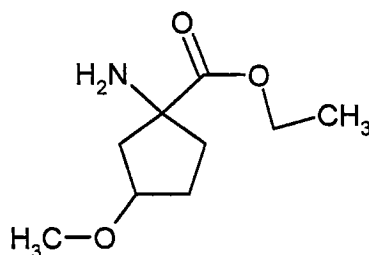
[1122] 然后加入 0.6l 水和 1.2l 乙酸, 并将该溶液在内部温度 55°C 下搅拌 8h。将该混合物静置过夜然后浓缩, 加入 0.6l 水, 用碳酸氢钠将 pH 值调节至 pH = 7, 再浓缩该混合物。分三次每次向以此方式得到的剩余物中加入 0.4l 二氯甲烷, 并用硫酸钠干燥合并的有机相。这样得到 9.8g 粘性油状的产物。(理论产量的 54.2%)

[1123] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz): δ = 4.20 (m, 2H, OCH_2), 4.35 和 4.50 (各自为 m, 总体为 1H, CH-OH) ppm。

[1124] *二溴化物 A = 1,4-二溴-2-(2'-四氢吡喃基)氧化丁烷

[1125] 3-甲氧基-1-氨基-1-环戊羧酸乙酯 (XIV-1)

[1126]



[1127] 以与 A. Börner 等人, Chem. Ber. 128, 767 (1995)

[1128] Ma, Dawei 等人, Tetrahedron

[1129] Asymmetry 8, 825 (1997) 类似的方式

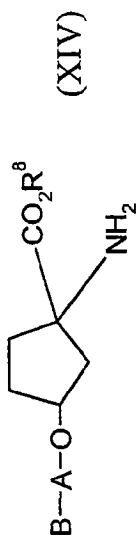
[1130] 将 0.637g 氢化钠 (60%, 2.2 当量) 悬浮于 20ml 无水四氢呋喃中, 并将溶于 100ml 四氢呋喃中的 1.935g N-二苯基亚甲基氨基乙酸乙酯 (1 当量) 在 30 分钟内逐滴加入。搅拌该混合物 30 分钟, 然后在 30 分钟内加入溶于 10ml 四氢呋喃中的双甲磺酰化物 (bismesylate) A*。先将该混合物回流搅拌 4h, 然后于室温下搅拌过夜。

[1131] 然后向溶液中加入 40ml 水和 80ml 乙酸, 并将混合物在内部温度 55°C 下搅拌 8h。将该混合物静置过夜然后浓缩, 加入 50ml 水, 用碳酸氢钠将 pH 值调至 pH = 7, 并将该混合物再次浓缩。分三次每次向所得的剩余物中加入 0.1l 二氯甲烷, 并用硫酸钠干燥合并的有机相。这样得到 0.75g 粘性油状的产物。(理论产量的 52.7%)。

[1132] *双甲磺酰化物 A = 2-甲氧基-1,4-丁二醇-双甲磺酰化物

[1133]

以与实施例(XIV-1)类似的方式并根据关于制备的总的描述,得到以下式(XIV)化合物:



实施例 编号	A	B	R ⁸	熔点 (°C)	异构体
XIV-2	(CH ₂) ₂	OCH ₃	C ₂ H ₅	油状 直接进行下一步反应	混合物 顺式/反式
XIV-3	CH ₂		C ₂ H ₅	油状 0.52 (m, 1H, <u>CH</u> -环丙基), 1.28 ppm (m, 3H, O-CH ₂ - <u>CH</u> ₃), 3.24 ppm (m, 2H, O- <u>CH</u> ₂ -环丙基)	混合物 顺式/反式
XIV-4	CH ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	油状 直接进行下一步反应	混合物 顺式/反式
XIV-5	CH ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	油状 4.18 ppm (m, 2H, <u>CH</u> ₂ -O), 4.18 及 4.01 ppm (各自为 m, 总体为 1H, <u>CH</u> -O), 3.39 ppm (m, 2H, O <u>CH</u> ₂)	混合物 顺式/反式
XIV-6	CH ₂	C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	油状 4.18 ppm (m, 2H, <u>CH</u> ₂ -O), 4.18 及 4.01 ppm (各自为 m, 总体为 1H, <u>CH</u> -O), 3.39 ppm (m, 2H, O <u>CH</u> ₂)	混合物 顺式/反式

* ^1H -NMR (300 MHz, CDCl_3): 位移 δ 的单位为 ppm

[1134] 用途实施例

[1135] 实施例 1

[1136] 猿叶虫试验 (PHAECO 喷洒处理)

[1137] 溶剂： 78 重量份丙酮

[1138] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[1139] 乳化剂:0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[1140] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份的活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将浓液用含有乳化剂的水稀释至所需浓度。

[1141] 用所需浓度的活性化合物制剂喷洒大白菜 (*Brassica pekinensis*) 的圆叶片,并在其变干后,接入辣根猿叶甲 (*Phaedon cochleariae*) 幼虫。

[1142] 经过所需时间后,确定以%计的药效。100%表示所有猿叶虫幼虫被杀死;0%表示无猿叶虫幼虫被杀死。

[1143] 本试验中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为 500g/ha 时表现出 $\geq 80\%$ 的 药 效 :I-1-a-1、I-1-a-2、I-1-a-6、I-1-a-9、I-1-a-10、I-1-a-13、I-1-a-16、I-1-a-17、I-1-a-18、I-1-b-5、I-1-c-4、I-1-c-5、I-1-c-6、I-1-c-10、I-1-c-13、I-1-c-14、I-1-c-15、I-1-c-16、I-1-c-17、I-1-c-20。

[1144] 实施例 2

[1145] 桃蚜试验 (MYZUPE 喷洒处理)

[1146] 溶剂: 78 重量份丙酮

[1147] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[1148] 乳化剂:0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[1149] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份的活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将浓液用含有乳化剂的水稀释至所需浓度。

[1150] 用所需浓度的活性化合物制剂喷洒被所有阶段的绿桃蚜 (*Myzus persicae*) 侵染的大白菜 (*Brassica pekinensis*) 的圆叶片。

[1151] 经过所需时间后,确定以%计的药效。100%表示已杀死所有蚜虫;0%表示无蚜虫被杀死。

[1152] 本试验中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为 500g/ha 时表现出 $\geq 80\%$ 的 药 效 :I-1-a-1、I-1-a-2、I-1-a-3、I-1-a-6、I-1-a-7、I-1-a-9、I-1-a-10、I-1-a-11、I-1-a-12、I-1-a-13、I-1-a-15、I-1-a-16、I-1-a-17、I-1-a-18、I-1-a-19、I-1-a-21、I-1-a-22、I-1-a-24、I-1-a-25、I-1-a-26、I-1-b-1、I-1-b-2、I-1-b-5、I-1-c-2、I-1-c-3、I-1-c-4、I-1-c-5、I-1-c-6、I-1-c-8、I-1-c-14、I-1-c-15、I-1-c-16、I-1-c-17、I-1-c-19、I-1-c-20、I-1-c-22、I-1-c-23、I-1-c-24、I-1-c-25、I-1-c-26、I-1-c-27、I-1-c-28、I-1-c-29。

[1153] 实施例 3

[1154] 草地夜蛾试验 (SPODFR 喷洒处理)

[1155] 溶剂: 78 重量份丙酮

[1156] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[1157] 乳化剂:0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[1158] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份的活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将浓液用含有乳化剂的水稀释至所需浓度。

[1159] 用所需浓度的活性化合物制剂喷洒玉米叶 (*Zea mays*) 的圆叶片,并在变干后,接入草地夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*) 幼虫。

[1160] 经过所需时间后,确定以%计的药效。100%表示已杀死所有幼虫;0%表示无幼虫

被杀死。

[1161] 本试验中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为 500g/ha 时表现出 $\geq 80\%$ 的药效:I-1-a-1、I-1-a-10、I-1-a-11、I-1-a-16、I-1-a-25、I-1-a-26、I-1-b-5、I-1-c-6、I-1-c-15、I-1-c-16、I-1-c-20。

[1162] 实施例 4

[1163] 叶螨 (*Tetranychus*) 试验 ;OP 抗性 (TETRUR 喷洒处理)

[1164] 溶剂: 7 重量份的二甲基甲酰胺

[1165] 乳化剂:2 重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

[1166] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份的活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将浓液用含有乳化剂的水稀释至所需浓度。

[1167] 用所需浓度的活性化合物制剂喷洒被所有阶段的二斑叶螨 (*Tetranychus urticae*) 侵染的菜豆叶片 (*Phaseolus vulgaris*) 的圆叶片。

[1168] 经过所需时间后,确定以%计的药效。100%表示已杀死所有叶螨;0%表示无叶螨被杀死。

[1169] 本试验中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为 100g/ha 时表现出 $\geq 80\%$ 的药效:I-1-a-10、I-1-a-21、I-1-a-22、I-1-a-24、I-1-a-25、I-1-a-26、I-1-b-1、I-1-b-4、I-1-b-5、I-1-c-3、I-1-c-4、I-1-c-5、I-1-c-13、I-1-c-14、I-1-c-15、I-1-c-16、I-1-c-20、I-1-c-21、I-1-c-22、I-1-c-23、I-1-c-24、I-1-c-25、I-1-c-26、I-1-c-27、I-1-c-28、I-1-c-29。

[1170] 实施例 5

[1171] 苗前除草作用

[1172] 将单子叶和双子叶杂草以及作物植物的种子置于木质纤维罐中的砂壤土中,并用土壤覆盖。然后,将制成可湿性粉剂 (WP) 形式的或乳油 (EC) 形式的供试化合物以加入 0.2%湿润剂的水悬浮液的形式以 800l/ha (已换算) 的水施用率施用在覆盖土壤的表面。

[1173] 处理后,将罐置于温室中,并在供试植物的良好生长条件下静置。在 3 周的试验期后,通过与未处理的对照组对比目测评价对供试植株的损害情况 (以百分数 (%) 计的除草活性:100%活性=植株死亡,0%活性=与对照组植株类似)。

[1174] 通过苗前方法以 320g 有效成分/ha 施用,以下化合物对黑麦草 (*Lolium multiflorum*) 和狗尾草 (*Setaria viridis*) 显示出 $\geq 80\%$ 的药效:I-1-a-2、I-1-a-8。

[1175] 通过苗前方法以 320g 有效成分/ha 施用,以下化合物对黑麦草和稗 (*Echinochloa crus-gali*) 显示出 $\geq 80\%$ 的药效:I-1-a-2、I-1-a-3、I-1-a-5、I-1-a-6、I-1-a-7、I-1-a-10、I-1-a-11、I-1-a-12、I-1-a-19、I-1-a-20、I-1-b-2、I-1-b-3、I-1-b-4、I-1-c-1、I-1-c-2、I-1-c-3、I-1-c-7、I-1-c-9、I-1-c-10、I-1-c-11、I-1-c-15、I-1-c-16、I-1-c-18、I-1-c-20。

[1176] 苗后除草作用

[1177] 将单子叶和双子叶的杂草和作物植物的种子置于木质纤维罐中的砂壤土中,用土壤覆盖并在温室中在良好生长条件下培养。播种后 2-3 周,在一叶期处理供试植株。然后将制成可湿性粉剂 (WP) 或乳油 (EC) 形式的供试化合物以 800l/ha 的水施用率 (已换算)——添加 0.2%的湿润剂——以水悬浮液的形式喷洒在植物的绿色部位上。将供试植株在温室

中在最佳生长条件下保持约 3 周后,通过与经处理的对照组对比目测评价制剂的活性(以百分比(%)表示除草活性:100%活性=植株已死亡,0%活性=与对照植株类似)。

[1178] 通过苗后方法以 320g 有效成分/ha 施用,以下化合物对野燕麦 (*Avena fatua*)、黑麦草和狗尾草以及稗显示出生效 $\geq 80\%$ 的药效:I-1-a-2、I-1-a-3、I-1-a-7、I-1-a-8、I-1-a-12、I-1-a-20、I-1-b-2、I-1-b-3、I-1-c-1、I-1-c-2、I-1-c-11、I-1-c-20。

[1179] 实施例 6

[1180] 苗后除草作用

[1181] 将单子叶和双子叶的杂草和作物植物的种子置于木质纤维罐或塑料罐中的砂壤土中,用土壤覆盖并在良好的生长条件下在温室中培养、在营养生长期还放置在温室户外。播种后 2-3 周,在一叶期至三叶期时处理供试植物。然后将制成可湿性粉剂 (WP) 或液体 (EC) 形式的供试化合物以多种不同剂量、300l/ha 的水施用率(已换算)——添加湿润剂(0.2% -0.3%)——喷洒在植物和土壤表面。供试植物处理 3 至 4 周后,通过与未处理的对照组对比目测评价制剂的效果(以百分比(%)表示除草效果:100%效果=植株死亡,0%效果=与对照植物类似)。

[1182] 安全剂的使用

[1183] 如果另外要测试安全剂是否能提高供试物质对作物植物的植物相容性,则使用以下选项的方法施用安全剂:

[1184] - 将作物植物的种子在播种之前用安全剂物质拌种(安全剂的量以百分比表示,基于种子的重量计)

[1185] - 在施用供试物质之前,将作物植物用安全剂以每公顷一定的施用率喷洒(通常在施用供试物质之前 1 天)

[1186] - 将安全剂与供试物质以桶混的形式共同施用(安全剂的量以 g/ha 或以基于除草剂计的比例表示)。

[1187] 通过比较供试物质在用或不用安全剂处理的情况下对作物植物的效果,可评价安全剂物质的作用。

[1188] 室外谷类容器试验(“鸟笼”)

[1189] 施用除草剂之前 1 天施用吡咯二酸 (mefenpyr)

[1190]

	施用率 g 有效成分/ha	夏季大麦 28 天后观测值 (%)
实施例 (I-1-c-2)	50	90
	25	65
实施例 (I-1-c-2) + 吡咯二酸	50 + 100	30
	25 + 100	15

[1191]

	施用率 g 有效成分/ha	夏季小麦 10 天后观测值 (%)
实施例 (I-1-a-4)	50	40
	25	25
实施例 (I-1-a-4) + 吡咯二酸	50 + 100	20
	25 + 100	10

[1192]

	施用率 g 有效成分/ha	夏季小麦 28 天后观测值 (%)
实施例 (I-1-a-3)	50	70
	25	40
实施例 (I-1-a-3) + 吡咯二酸	50 + 100	30
	25 + 100	20

[1193] 温室中和室外谷类容器实验 (“鸟笼”)

[1194] 施用除草剂之前 1 天施用吡咯二酸

[1195] 施用后 28 天

[1196]

	施用率 g 有效成分/ha	夏季大麦 观测值 (%)	夏季小麦 观测值 (%)
实施例 (I-1-a-2)	100	95	75
	50	70	70
	25	50	40
实施例 (I-1-a-2) + 吡咯二酸	100 + 100	50	30
	50 + 100	40	25
	25 + 100	30	20

[1197] 施用后 10 天

[1198]

	施用率 g 有效成分/ha	夏季大麦 观测值 (%)
实施例 (I-1-a-3)	50	70
	25	70
	12.5	60
	6.25	20
实施例 (I-1-a-3) +吡咯二酸	50 + 100	40
	25 + 100	10
	12.5 + 100	5
	6.25 + 100	0

[1199] 施用后 28 天

[1200]

	施用率 g 有效成分/ha	夏季小麦 观测值 (%)
实施例 (I-1-c-2)	50	70
	25	50
	12.5	30
	6.25	20
实施例 (I-1-c-2) +吡咯二酸	50 + 100	20
	25 + 100	15
	12.5 + 100	10
	6.25 + 100	10

[1201] 施用后 28 天

[1202]

	施用率 g 有效成分/ha	夏季大麦 观测值 (%)	夏季小麦 观测值 (%)
实施例 (I-1-a-5)	25	85	
	12.5	70	80
	6.25	30	70
	3.125		30
实施例 (I-1-a-5) + 吡咯二酸	25 + 100	60	
	12.5 + 100	30	60
	6.25 + 100	10	15
	3.125 + 100		0

[1203] 施用后 10 天

[1204]

	施用率 g 有效成分/ha	夏季大麦 观测值 (%)	夏季小麦 观测值 (%)
实施例 (I-1-a-7)	100	60	50
	50	60	50
	25	40	40
实施例 (I-1-a-7) + 吡咯二酸	100 + 100	15	10
	50 + 100	10	5
	25 + 100	5	3

[1205] 实施例 7

[1206] 美洲烟夜蛾试验——处理转基因植物

[1207] 溶剂：7 重量份丙酮

[1208] 乳化剂：1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[1209] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份的活性化合物与所述量的溶剂和所述量的乳化剂混合，并将浓液用水稀释至所需浓度。

[1210] 将 Roundup Ready (商标，来自 Monsanto Comp., 美国) 品种的大豆 (Glycine max) 幼苗浸入所需浓度的活性化合物制剂中处理，在叶片仍湿润时接入美洲烟夜蛾 (*Heliothis virescens*) 幼虫。

[1211] 经过所需时间后，确定昆虫死亡率。

[1212] 实施例 8

[1213] 临界浓度 (critical concentration) 试验 / 土壤昆虫——处理转基因植物

[1214] 供试昆虫：黄瓜条叶甲 (*Diabrotica balteata*)——土壤中的幼虫

[1215] 溶剂：7 重量份丙酮

[1216] 乳化剂：1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[1217] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份的活性化合物与所述量的溶剂混合，加入所述量的乳化剂并将浓液用水稀释至所需浓度。

[1218] 将该活性化合物制剂倒在土壤上。此处制剂中活性化合物的浓度实际上不重要；只有以 ppm(mg/l) 表示的每单位体积土壤中的活性化合物的重量是重要的。将土壤装入 0.25l 罐中，使其保持在 20℃。

[1219] 制备后，立刻将 5 颗 YIELD GUARD(商标，来自 Monsanto Comp.，美国)品种的经过催芽的玉米置于每个罐中。2 天后，将适合的供试昆虫放入经过处理的土壤中。再过 7 天后，通过计数长出的玉米植株数确定活性化合物的药效(1 株植物 = 20%活性)。