

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl.

C07D 277/24 (2006.01)

C07D 417/12 (2006.01)

A01N 43/78 (2006.01)



[12] 发明专利说明书

专利号 ZL 200610095633.0

[45] 授权公告日 2009 年 9 月 9 日

[11] 授权公告号 CN 100537551C

[22] 申请日 2002.4.2

[21] 申请号 200610095633.0

分案原申请号 02811656.9

[30] 优先权

[32] 2001.4.12 [33] DE [31] 10118310.0

[73] 专利权人 拜尔农作物科学股份公司

地址 德国蒙海姆

[72] 发明人 R·菲舍尔 A·乌尔曼

A·特劳特魏因 M·W·德雷维斯

C·埃尔德伦 P·达门

D·福伊希特 R·庞岑

K·-H·库克

U·瓦亨多夫-纽曼

[56] 参考文献

CN1303375A 2001.7.11

CN1204313A 1999.1.6

EP0368592 A 1990.5.16

审查员 王晓洪

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 李连涛

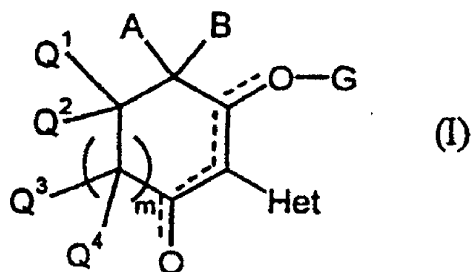
权利要求书 14 页 说明书 94 页

[54] 发明名称

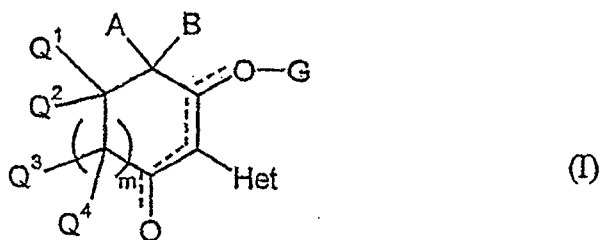
作为杀虫剂的被噻唑基取代的碳环 1,3-二酮类化合物

[57] 摘要

本发明涉及式(I)的新的被杂芳基取代的碳环-1,3-二酮类化合物,其多种制备方法以及其作为杀虫剂、除草剂和杀真菌剂的用途,其中 A、B、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、G、m 和 Het 具有说明书中给出的含义。

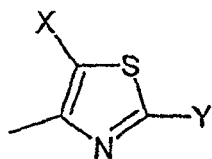


1. 式(I)化合物,



其中

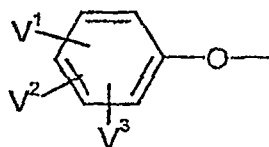
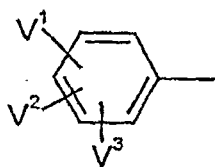
Het 表示



m 表示数字 0 或 1,

X 表示氢、卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_3-C_6 -烯基氧基、硝基或氰基,

Y 表示卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基或表示基团

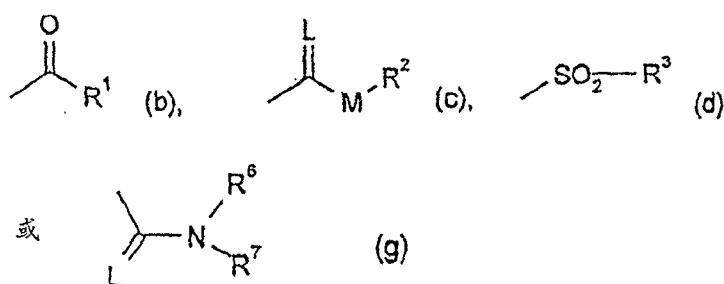


V^1 表示氢、卤素、 C_1-C_{12} -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷硫基、 C_1-C_6 -烷基亚硫酰基、 C_1-C_6 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、硝基、氰基或各自任选被卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、硝基或氰基一或多取代的苯基、苯氧基、苯氧基- C_1-C_4 -烷基、苯基- C_1-C_4 -烷氧基、苯硫基- C_1-C_4 -烷基或苯基- C_1-C_4 -烷硫基,

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

A 表示氢或各自任选被卤素取代的 C_1-C_{12} -烷基、 C_3-C_8 -烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、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_8 -环烷基或 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_4 -烷基, 其中任选一个环成员被氧或硫替代或表示各自任选被卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、氰基或硝基取代的苯基或苄基, B 表示氢或 C_1-C_6 -烷基, 或
- A、B 和与其相连接的碳原子一起表示饱和的 C_3-C_{10} -环烷基或不饱和的 C_3-C_{10} -环烷基, 其中任选一个环成员被氧或硫替代并且其任选被 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_8 -环烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷硫基、卤素或苯基一或二取代,
- A 和 Q^1 一起表示任选被 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基一或二、相同或不同地取代的 C_3-C_6 -烷二基,
- Q^1 表示氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_2 -烷基、任选被氟、氯、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_2 -卤代烷基或 C_1-C_4 -烷氧基取代的 C_3-C_8 -环烷基, 其中任选一个亚甲基被氧或硫替代或各自任选被卤素、 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、氰基或硝基取代的苯基,
- Q^2 、 Q^3 、 Q^4 相互独立表示氢或 C_1-C_4 -烷基,
- Q^1 和 Q^2 与和其相连的碳原子一起表示任选被 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基或 C_1-C_2 -卤代烷基取代的 C_3-C_7 -环烷基, 其中任选一个环成员被氧或硫替代,
- G 表示氢 (a) 或表示下述基团之一



其中

L 表示氧, 和

M 表示氧或硫,

R^1 表示各自任选被卤素取代的 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、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -

烷基或任选被卤素、 C_1-C_6 -烷基或 C_1-C_6 -烷氧基取代的 C_3-C_8 -环烷基，其中任选一或多个不相邻的环成员被氧和/或硫替代，

表示任选被卤素、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，

表示任选被卤素、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，

表示各自任选被氟、氯、溴、甲基、乙基或三氟甲基单取代的吡啶基或噻吩基，

或

表示任选被卤素或 C_1-C_6 -烷基取代的苯氧基- C_1-C_6 -烷基，

R^2 表示各自任选被卤素取代的 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、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_2-C_8 -烷基，

表示任选被卤素、 C_1-C_6 -烷基或 C_1-C_6 -烷氧基取代的 C_3-C_8 -环烷基，

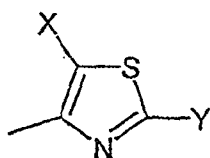
或
表示各自任选被卤素、氰基、硝基、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷基或 C_1-C_6 -卤代烷氧基取代的苯基或苄基，

R^3 表示任选被卤素取代的 C_1-C_8 -烷基或表示各自任选被卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、氰基或硝基取代的苯基或苄基，

R^6 和 R^7 相互独立表示氢，表示各自任选被卤素取代的 C_1-C_8 -烷基、 C_3-C_8 -环烷基、 C_1-C_8 -烷氧基、 C_3-C_8 -烯基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基，表示任选被卤素、 C_1-C_8 -卤代烷基、 C_1-C_8 -烷基或 C_1-C_8 -烷氧基取代的苯基、任选被卤素、 C_1-C_8 -烷基、 C_1-C_8 -卤代烷基或 C_1-C_8 -烷氧基取代的苄基或一起表示与和它们连接的氮相连的、任选被 C_1-C_4 -烷基取代的 C_3-C_6 -亚烷基，其中任选一个碳原子被氧或硫替代。

2. 按照权利要求 1 的式 (I) 化合物，其中

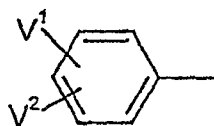
Het 表示



m 表示数字 0 或 1,

X 表示氢、氯、溴或 C_1-C_4 -烷基,

Y 表示氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基, 或表示基团



V^1 表示氢、氟、氯、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_2 -卤代烷基、 C_1-C_2 -卤代烷氧基、硝基、氰基或任选被氟、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、硝基或氰基一或二取代的苯氧基,

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

A 表示氢, 表示各自任选被氟一至三取代的 C_1-C_8 -烷基或 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_2 -烷基, 表示各自任选被氟、氯、甲基、乙基或甲氧基一至二取代的 C_5-C_6 -环烷基或 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_2 -烷基, 其中任选一个环成员被氧或硫替代或表示各自任选被氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_2 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_2 -卤代烷氧基一至二取代的苯基或苄基,

B 表示氢或 C_1-C_4 -烷基, 或

A、B 和与其相连接的碳原子一起表示饱和的 C_5-C_6 -环烷基, 其中任选一个环成员被氧替代和其任选被 C_1-C_4 -烷基、三氟甲基或 C_1-C_4 -烷氧基单取代,

条件是, 在这种情况下 Q^1 只表示氢或 C_1-C_4 -烷基,

A 和 Q^1 一起表示任选被甲基、乙基、甲氧基或乙氧基一或二取代的 C_3-C_4 -烷二基,

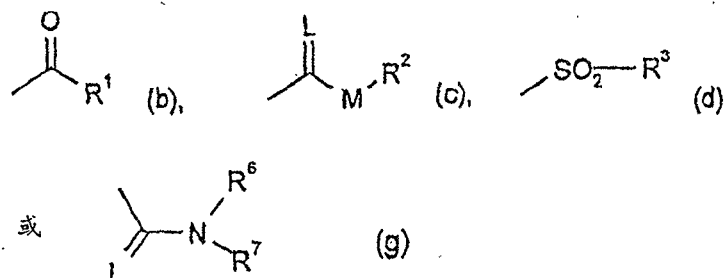
Q^1 表示氢、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_2 -烷基, 或表示任选被甲基或甲氧基取代的 C_3-C_6 -环烷基, 其中任选一个亚甲基被氧替代, 或表示各自任选被氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、三氟甲基或三氟甲氧基一至二取代的苯基或苄基,

Q^2 、 Q^3 、 Q^4 相互独立表示氢、甲基或乙基,

Q^1 和 Q^2 与和其相连的碳原子一起表示任选被 C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_4 -烷氧基

取代的饱和的 C_3-C_6 -环烷基，其中任选一个环成员被氧替代，
条件是，在这种情况下 A 只表示氢或 C_1-C_4 -烷基，

G 表示氢 (a) 或表示下述基团之一



其中

L 表示氧，和

M 表示氧或硫，

R^1 表示各自任选被氟或氯一至五取代的 C_1-C_{16} -烷基、 C_2-C_{16} -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，或任选被氟、氯、 C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_5 -烷氧基一至二取代的 C_3-C_6 -环烷基，其中任选一个环成员被氧或硫替代，

表示任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、三氟甲基或三氟甲氧基一至二取代的苯基，

表示各自任选被氟、氯、溴、甲基、乙基或三氟甲基单取代的吡啶基或噻吩基，

R^2 表示 C_1-C_{16} -烷基、 C_2-C_{16} -烯基或 C_1-C_4 -烷氧基- C_2-C_4 -烷基，

表示任选被甲基、乙基或甲氧基一至二取代的 C_3-C_6 -环烷基，

表示各自任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、三氟甲基或三氟甲氧基一至二取代的苯基或苄基，

R^3 表示任选被氟一至五取代的 C_1-C_4 -烷基或表示任选被氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或硝基一至二取代的苯基，

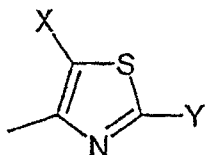
R^6 表示氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_3-C_6 -烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基，表示任选被氟、氯、溴、三氟甲基、 C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_4 -烷氧基一至二取代的苯基，表示任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基或甲氧基取代的苄基，

R^7 表示氢、 C_1-C_6 -烷基或 C_3-C_6 -烯基，

R^6 和 R^7 一起表示与和它们连接的氮相连的、任选被甲基或乙基一至二取代的 C_5-C_6 -亚烷基, 其中任选一个亚甲基被氧或硫替代。

3. 按照权利要求 1 的式 (I) 化合物, 其中

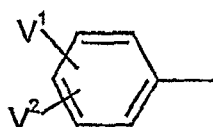
Het 表示



m 表示数字 0 或 1,

X 表示氢、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基,

Y 表示基团



V^1 表示氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、三氟甲基、三氟甲氧基或 4-氯苯氧基,

V^2 表示氢、氟、氯、溴、甲基、甲氧基或三氟甲基,

A 表示氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、苯基或环己基,

B 表示氢、甲基或乙基, 或

A 、 B 和与其相连的碳原子一起表示饱和的 C_5-C_6 -环烷基, 其中任选一个环成员被氧替代和其任选被甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、正丁氧基或异丁氧基单取代,

条件是, 在这种情况下 Q^1 仅表示氢,

A 和 Q^1 一起表示 C_3-C_4 -烷二基,

Q^1 表示氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、环丙基、环戊基、环己基或 4-氯苯基,

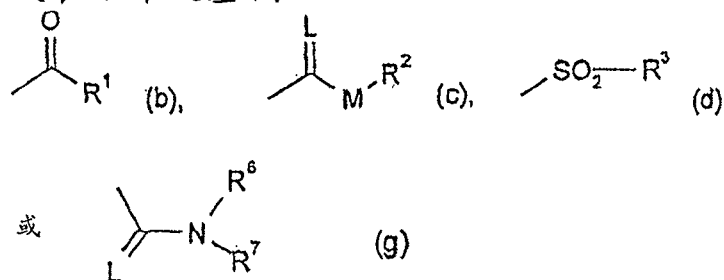
Q^2 、 Q^3 、 Q^4 相互独立表示氢、甲基或乙基,

Q^1 和 Q^2 与和它们连接的碳原子一起表示任选被甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或正丁氧基取代的饱和的 C_5-C_6 -环烷基, 其中

任选一个环成员被氧替代,

条件是, 在这种情况下 A 仅表示氢,

G 表示氢 (a) 或表示下述基团之一



其中

L 表示氧, 和

M 表示氧或硫,

R¹ 表示各自任选被氟或氯取代的 C₁-C₈-烷基、C₂-C₈-烯基、C₁-C₂-烷氧基-C₁-C₂-烷基、C₁-C₂-烷硫基-C₁-C₂-烷基或各自任选被氟、氯、甲基、乙基或甲氧基单取代的环丙基或环己基,

表示任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、甲基、乙基、异丙基、叔丁基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基单取代的苯基,

表示各自任选被氟、氯、溴或甲基单取代的噻吩基或吡啶基,

R² 表示 C₁-C₈-烷基、C₂-C₈-烯基或 C₁-C₄-烷氧基-C₂-烷基,

表示任选被甲基、乙基或甲氧基单取代的 C₃-C₆-环烷基,

表示各自任选被氟、氯、氰基、硝基、甲基、乙基、异丙基、叔丁基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基单取代的苯基或苄基,

R³ 表示各自任选被氟三取代的甲基或乙基或任选被氟、氯、溴、甲基、叔丁基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或硝基单取代的苯基,

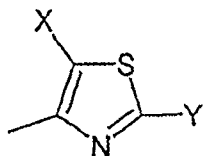
R⁶ 表示氢, 表示 C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₃-C₄-烯基或 C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基,

R⁷ 表示氢、C₁-C₄-烷基或 C₃-C₄-烯基,

R⁶ 和 R⁷ 一起表示与和它们连接的氮相连的 C₅-亚烷基, 其中任选一个亚甲基被氧替代。

4. 按照权利要求 1 的式 (I) 化合物, 其中

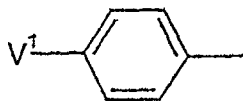
Het 表示



m 表示数字 0 或 1,

X 表示氢、甲基或乙基,

Y 表示基团



V¹ 表示氢、氯、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、三氟甲基或表示 4-氯苯氧基,

A 表示氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、苯基或环己基,

B 表示氢、甲基或乙基, 或

A、B 和与其相连的碳原子一起表示饱和的 C₅-C₆-环烷基, 其中任选一个环成员被氧替代和其任选被甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、正丁氧基或异丁氧基单取代,

条件是, 在这种情况下 Q¹ 仅表示氢,

A 和 Q¹ 一起表示 C₃-C₄-烷二基,

Q¹ 表示氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基或 4-氯苯基,

Q² 表示氢、甲基或乙基,

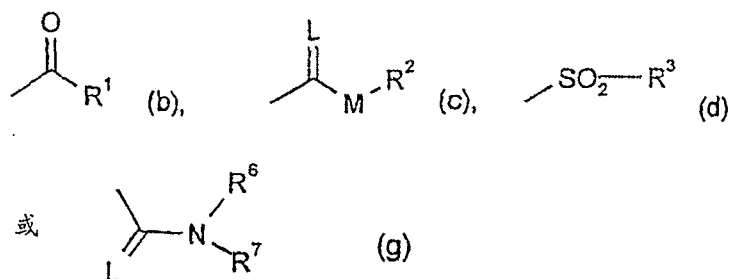
Q³ 表示氢,

Q⁴ 表示氢,

Q¹ 和 Q² 与和它们连接的碳原子一起表示饱和的 C₅-C₆-环烷基,

条件是, 在这种情况下 A 仅表示氢,

G 表示氢 (a) 或表示下述基团之一



其中

L表示氧, 和

M表示氧或硫,

R¹表示 C₁-C₈-烷基、C₁-C₂-烷氧基-C₁-C₂-烷基或任选被氯单取代的环丙基,

表示任选被氯单取代的苯基,

表示任选被氯单取代的吡啶基,

R²表示 C₁-C₈-烷基,

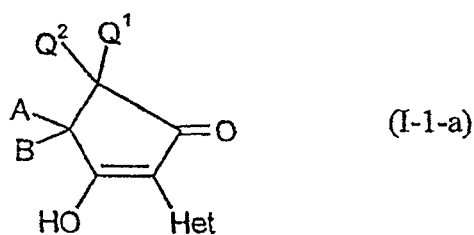
表示苯基或苄基,

R³表示甲基或乙基,

R⁶和 R⁷一起表示与和它们连接的氮相连的 C₅-亚烷基, 其中任选一个亚甲基被氧替代。

5. 制备按照权利要求 1 的式 (I) 化合物的方法, 其特征在于

(A) 式 (I-1-a) 的化合物

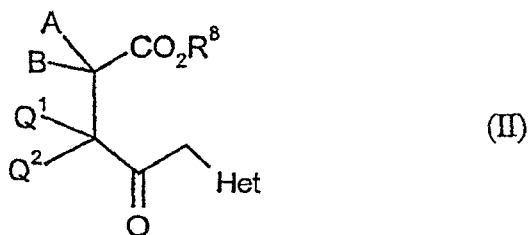


其中

A、B、Q¹、Q²和 Het 如权利要求 1 中所定义,

通过

式 (II) 的化合物



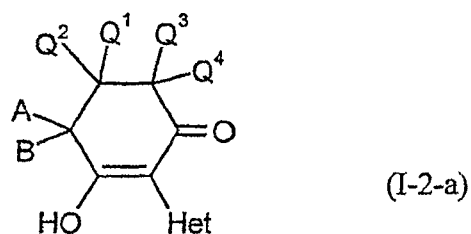
其中

A、B、Q¹、Q²和 Het 如权利要求 1 中所定义, 和

R⁸ 表示 C₁-C₆-烷基,

任选在稀释剂存在下和在碱存在下通过分子内缩合得到,

(B) 式 (I-2-a) 的化合物

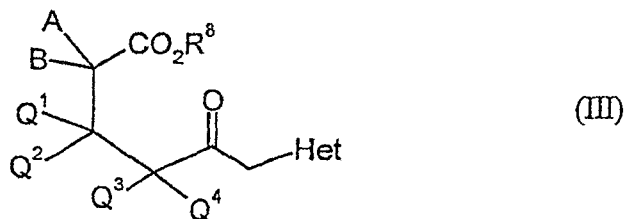


其中

A、B、Q¹、Q²、Q³、Q⁴和 Het 如权利要求 1 中所定义,

通过

式 (III) 的化合物



其中

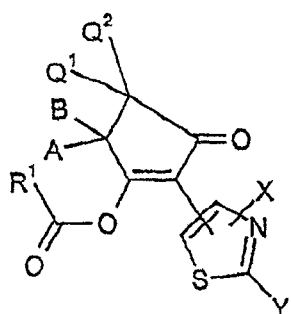
A、B、Q¹、Q²、Q³、Q⁴和 Het 如权利要求 1 中所定义, 和

R⁸ 表示 C₁-C₆-烷基,

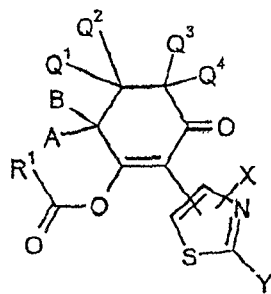
在稀释剂存在下和在碱存在下分子内缩合得到,

(C) 式 (I-1-b) 至 (I-2-b) 化合物,

(I-1-b):



(I-2-b):



其中 A、B、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、m、R¹ 和 Het 如权利要求 1 中所定义，
通过上述所示式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物，其中 A、B、Q¹、Q²、
Q³、Q⁴、m 和 Het 如权利要求 1 中所定义，分别

(α) 与式 (IV) 的酰卤

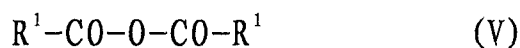


其中

R¹ 如权利要求 1 中所定义，和

Hal 表示卤素，或

(β) 与式 (V) 的酸酐



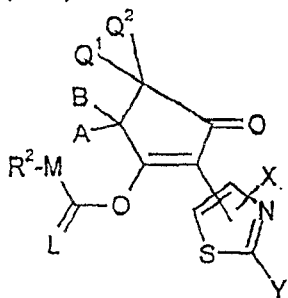
其中

R¹ 如权利要求 1 中所定义

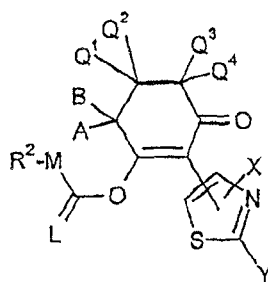
任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下反应得到；

(D) 式 (I-1-c) 至 (I-2-c) 化合物，

(I-1-c):



(I-2-c):



其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、m、 R^2 、M 和 Het 如权利要求 1 中所定义，和 L 表示氧，通过上述所示的式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物，其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、m 和 Het 如权利要求 1 中所定义，分别与式 (VI) 的氯甲酸酯或氯甲酸硫代酯



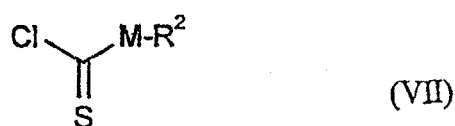
其中

R^2 和 M 如权利要求 1 中所定义，

任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下反应得到；

(E) 上述所示式 (I-1-c) 至 (I-2-c) 化合物，其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、m、 R^2 、M 和 Het 如权利要求 1 中所定义和 L 表示硫，

通过上述所示的式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物，其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、m 和 Het 如权利要求 1 中所定义，分别与式 (VII) 的氯一硫代甲酸酯或氯二硫代甲酸酯任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下反应得到

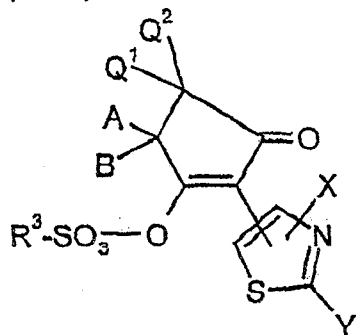


其中

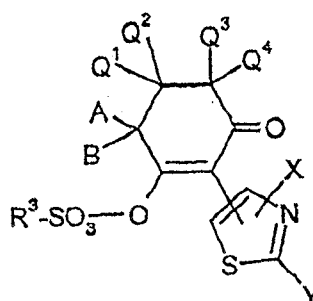
M 和 R^2 如权利要求 1 中所定义，和

(F) 式 (I-1-d) 至 (I-2-d) 化合物，

(I-1-d):



(I-2-d):



其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、m、 R^3 和 Het 如权利要求 1 中所定义，通过上述所示的式 (I-1-a) 和 (I-2-a) 化合物，其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、m 和 Het 如权利要求 1 中所定义，分别与式 (VIII) 的磺酰氯任选

在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下反应得到



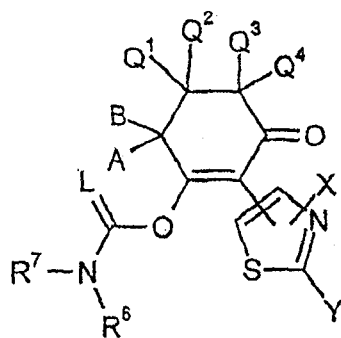
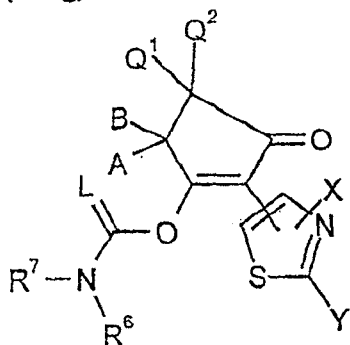
其中

R^3 如权利要求 1 中所定义,

(I) 式 (I-1-g) 至 (I-2-g) 化合物,

(I-1-g):

(I-2-g):



其中 A、B、L、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、m、 R^6 、 R^7 和 Het 如权利要求 1 中所定义,

通过上述所示的式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物, 其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、m 和 Het 如权利要求 1 中所定义, 分别

(α) 与式 (XII) 的异氰酸酯或异硫氰酸酯任选在稀释剂存在下和任选在催化剂存在下反应得到



其中

R^6 和 L 如权利要求 1 中所定义, 或

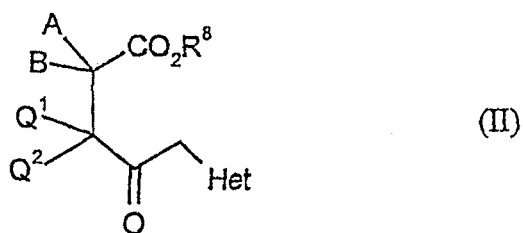
(β) 与式 (XIII) 的氨基甲酰氯或硫代氨基甲酰氯任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下反应得到



其中

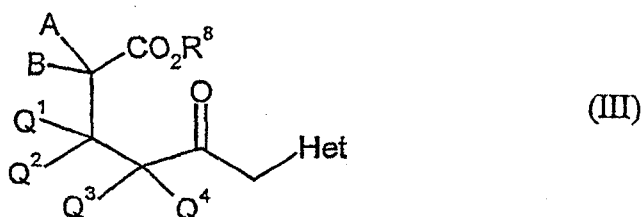
L、 R^6 和 R^7 如权利要求 1 中所定义。

6. 式 (II) 的化合物



其中 A、B、Q¹、Q² 和 Het 如权利要求 1 中所定义，和 R⁸ 表示 C₁-C₆-烷基。

7. 式 (III) 的化合物



其中 A、B、Q¹、Q²、Q³、Q⁴ 和 Het 如权利要求 1 中所定义，R⁸ 表示 C₁-C₆-烷基。

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

9. 防治有害动物、不希望的植物生长和真菌的方法，其特征在于将权利要求 1 的式 (I) 化合物作用于有害动物和/或它们的栖息地。

10. 权利要求 1 的式 (I) 化合物用于防治有害动物、不希望的植物生长和真菌的用途。

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

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

作为杀虫剂的被噻唑基取代的碳环 1,3-二酮类化合物

本申请是国际申请日为 2002 年 4 月 2 日(国际申请号为 PCT/EP02/03620)、进入国家阶段申请号为 02811656.9 的题为“作为杀虫剂的被噻唑基取代的碳环 1,3-二酮类化合物”的专利申请的分案申请。

技术领域

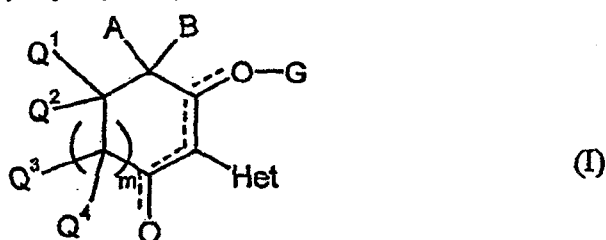
本发明涉及新的被杂芳基取代的环戊烷-和环己烷-1,3-二酮-衍生物,其多种制备方法以及其在农业中作为生物活性物质的应用。

背景技术

2-(2-氨基-噻唑-4-基)-3-羟基-5,5-二甲基-环己-2-烯酮是已知的;Pshenichnyi, V. N. 等;CNClALi; Chem. Heterocycl. Compd. (Engl. Transl.) EN; 26, 1175-1178 (1990)。

发明内容

现已发现新的式(I)化合物



其中

Het 表示任选被卤素、烷基、烷氧基、烯基氧基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代烯基氧基、氰基、硝基、烷硫基、烷基亚硫酰基、烷基磺酰基、任选被取代的苯基或苯氧基取代的含氮 5-元-杂环,优选噻唑基,

m 表示数字 0 或 1,

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

B 表示氢或烷基,

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

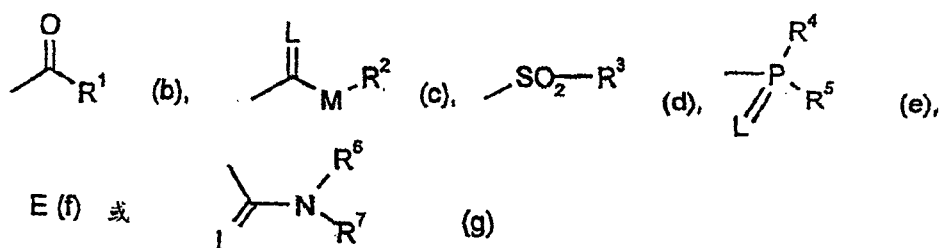
A 和 Q^1 一起表示任选被取代的烷二基, 其中两个不相邻的碳原子任选形成另一个任选被取代的环,

Q^1 表示氢、烷基、烷氧基烷基、任选被取代的环烷基(其中任选一个亚甲基被氧或硫代替)或各自任选被取代的苯基、杂芳基、苯基烷基或杂芳基烷基,

Q^2 、 Q^3 、 Q^4 相互独立表示氢或烷基,

Q^1 和 Q^2 与和它们连接的碳原子一起表示饱和的或不饱和的、任选含有一个杂原子的未被取代的或被取代的环,

G 表示氢(a)或表示下述基团之一



其中

E 表示金属离子或铵离子,

L 表示氧或硫,

M 表示氧或硫,

R^1 表示各自任选被卤素取代的烷基、烯基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、多烷氧基烷基或任选被卤素、烷基或烷氧基取代的环烷基, 其可任选被至少一个杂原子间隔、各自任选被取代的苯基、苯基烷基、杂芳基、苯氧基烷基或杂芳基氧基烷基,

R^2 表示各自任选被卤素取代的烷基、烯基、烷氧基烷基、多烷氧基烷基或者表示各自任选被取代的环烷基、苯基或苄基,

R^3 表示各自任选被取代的烷基、卤代烷基、苯基或苄基,

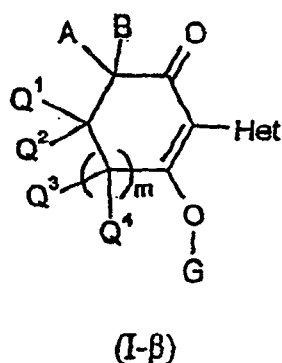
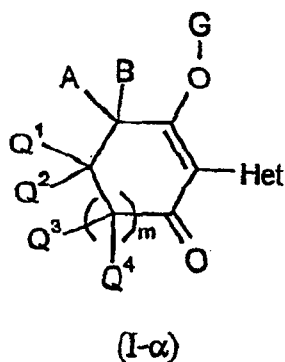
R^4 和 R^5 相互独立表示各自任选被卤素取代的烷基、烷氧基、烷基氨基、二烷基氨基、烷硫基、烯基硫基、环烷硫基或者表示各自任选被取代的苯基、苄基、苯氧基或苯硫基,

R^6 和 R^7 相互独立表示氢、各自任选被卤素取代的烷基、环烷基、烯基、烷氧基、烷氧基烷基, 表示任选被取代的苯基, 表示任选被取代的苄基, 或与和它们连接的氮原子一起表示任选被氧或硫间隔的环。

取决于取代基的种类, 式(I)化合物也可以几何和/或光学异构体或者以不同组成的异构体混合物形式存在。它们可任选按已知的方法分离。这些纯的异构体、异构体混合物、它们的制备和应用以及包含

它们的组合物都是本发明的主题。但是，在后面为了简单起见总是提及式(I)化合物，尽管这既指纯的化合物，也任选指具有不同异构体含量的混合物。

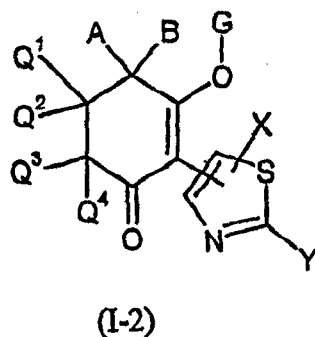
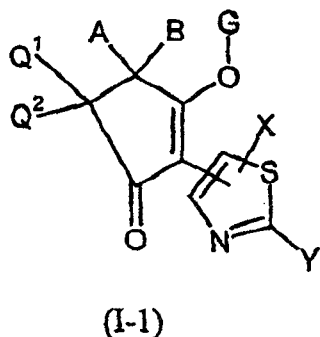
根据取代基 G 的位置的不同，式(I)化合物可以式(I- α)和(I- β)两种异构体形式存在。这两种异构形式是通过式(I)化合物中的虚线表示的。



式(I- α)和(I- β)化合物可以混合物或者以纯的异构体的形式存在。式(I- α)和(I- β)化合物的混合物可任选按已知方式通过物理方法，例如通过色谱方法分离。

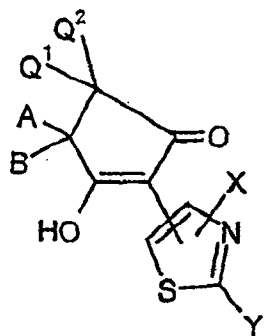
为了更清楚起见，下面在各种情况下只给出一种可能的异构体。这并不排除所述化合物可任选以异构体混合物或者以在每一种情况下的另一种异构体的形式存在。

如果 Het 表示噻唑基和 m 表示数字 0 和 1，则得到下述主要结构(I-1)和(I-2)

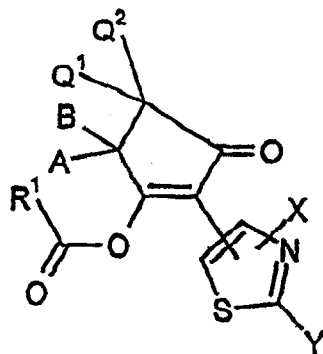


在基团 G 表示(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)和(g)不同的含义的情况下，如果 m 表示 0，则得到下述主要结构(I-1-a)至(I-1-g)

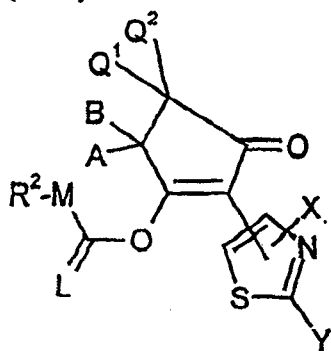
(I-1-a):



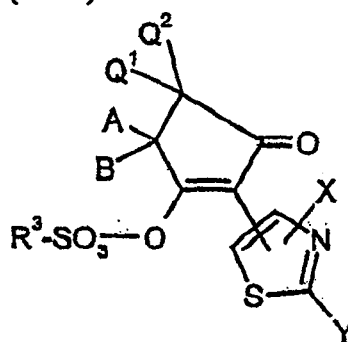
(I-1-b):



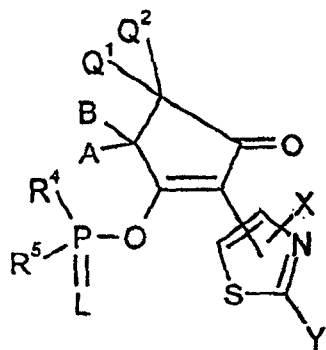
(I-1-c):



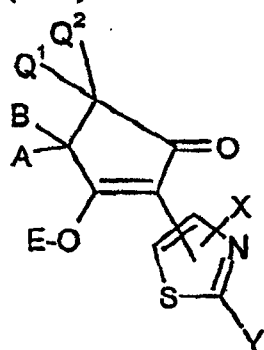
(I-1-d):



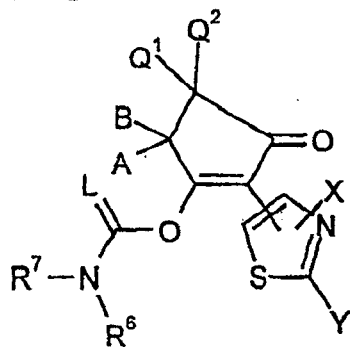
(I-1-e):



(I-1-f):



(I-1-g):



其中

A、B、E、L、M、Q¹、Q²、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和 R⁷具有上述含

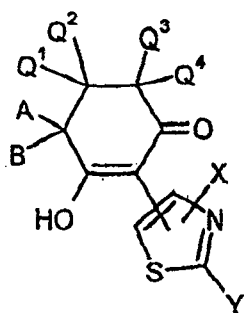
义, 和

X 表示氢、卤素、烷基、烷氧基、烯基氧基、硝基、氰基或任选取代的苯基, 和

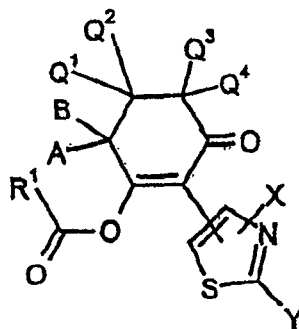
Y 表示卤素、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基或各自任选取代的苯基或苯氧基。

在基团 G 表示 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g) 不同的含义的情况下, 如果 m 表示 1, 则得到下述主要结构 (I-2-a) 至 (I-2-g)

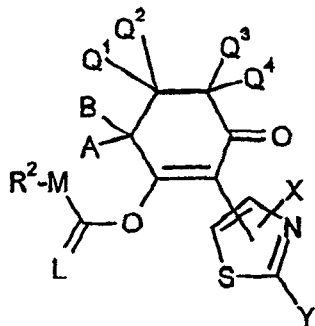
(I-2-a):



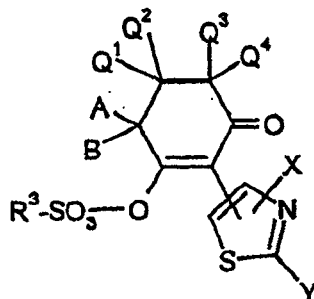
(I-2-b):



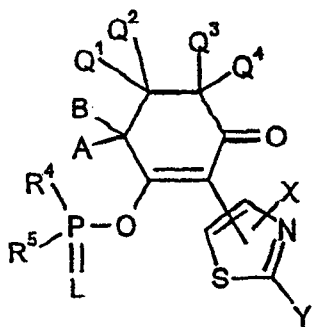
(I-2-c):



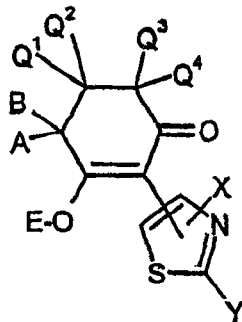
(I-2-d):



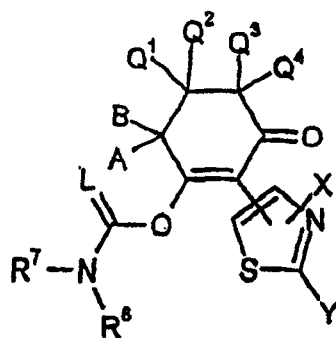
(I-2-e):



(I-2-f):



(I-2-g):

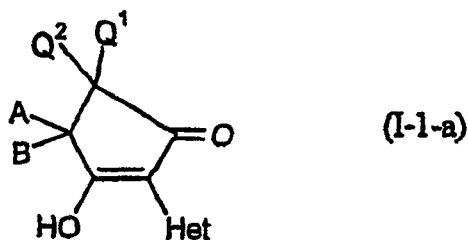


其中

A、B、E、L、M、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和 R⁷具有上述含义。

此外，已发现新的式(I)化合物可通过下述方法之一得到：

(A) 式(I-1-a)的被取代的环戊烷-1,3-二酮或其烯醇

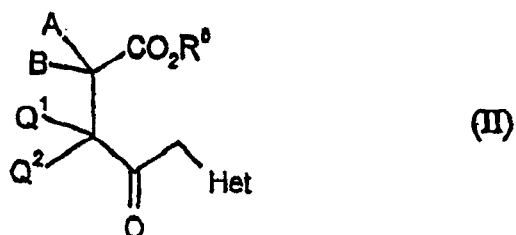


其中

A、B、Q¹、Q²和 Het 具有上述含义，

可通过

式(II)的酮酸酯



其中

A、B、Q¹、Q²和 Het 具有上述含义，

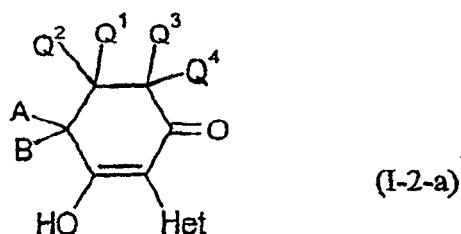
和

R¹表示烷基（优选 C₁-C₆-烷基），

任选在稀释剂存在下和任选在碱存在下通过分子内缩合得到。

此外, 已发现

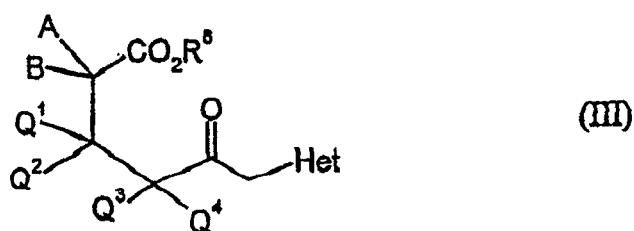
(B) 式(I-2-a)的被取代的环己烷-1,3-二酮



其中

A、B、Q¹、Q²、Q³、Q⁴和Het具有上述含义,
可通过

式(III)的酮酸酯



其中

A、B、Q¹、Q²、Q³、Q⁴和Het具有上述含义,
和

R⁸表示烷基(优选C₁-C₆-烷基),

在稀释剂存在下和任选在碱存在下分子内缩合得到。

此外, 已发现

(C) 上述所示式(I-1-b)至(I-2-b)化合物, 其中A、B、Q¹、Q²、
Q³、Q⁴、M、R¹和Het具有上述含义,

可通过上述所示式(I-1-a)至(I-2-a)化合物, 其中A、B、Q¹、Q²、
Q³、Q⁴、m和Het具有上述含义, 分别

(α) 与式(IV)的酰卤



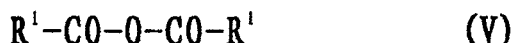
其中

R^1 具有上述含义, 和

Hal 表示卤素 (尤其是氯或溴),

或

(β) 与式 (V) 的酸酐



其中

R^1 具有上述含义

任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下反应得到;

(D) 上述所示的式 (I-1-c) 至 (I-2-c) 化合物, 其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、m、 R^2 、M 和 Het 具有上述含义, 和 L 表示氧, 可通过上述所示的式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物, 其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、m 和 Het 具有上述含义, 分别与式 (VI) 的氯甲酸酯或氯甲酸硫代酯



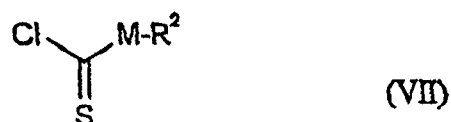
其中

R^2 和 M 具有上述含义,

任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下反应得到;

(E) 上述所示的式 (I-1-c) 至 (I-2-c) 化合物, 其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、m、 R^2 、M 和 Het 具有上述含义和 L 表示硫,

可通过上述所示的式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物, 其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、m 和 Het 具有上述含义, 分别与式 (VII) 的氯-硫代甲酸酯或氯二硫代甲酸酯任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下反应得到



其中

M 和 R^2 具有上述含义,

和

(F) 上述所示的式 (I-1-d) 至 (I-2-d) 化合物, 其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、m、 R^3 和 Het 具有上述含义, 可通过上述所示的式 (I-1-a) 和

(I-2-a)化合物, 其中 A、B、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、m 和 Het 具有上述含义, 分别与式(VIII)的磺酰氯任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下反应得到



其中

R³具有上述含义,

(G) 上述所示的式(I-1-e)至(I-2-e)化合物, 其中 A、B、L、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、m、R⁴、R⁵和 Het 具有上述含义,

可通过上述所示的式(I-1-a)至(I-2-a)化合物, 其中 A、B、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、m 和 Het 具有上述含义, 分别与式(IX)的磷化合物任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下反应得到



其中

L、R⁴和 R⁵具有上述含义, 和

Hal 表示卤素(尤其是氯或溴),

(H) 上述所示的式(I-1-f)至(I-2-f)化合物, 其中 A、B、E、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、m 和 Het 具有上述含义,

可通过式(I-1-a)至(I-2-a)化合物, 其中 A、B、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、m 和 Het 具有上述含义, 分别与式(X)或(XI)的金属化合物或胺任选在稀释剂存在下反应得到



其中

Me 表示一价或二价金属(优选碱金属或碱土金属, 如锂、钠、钾、镁或钙),

t 表示数字 1 或 2, 和

R¹¹、R¹²、R¹³相互独立表示氢或烷基(优选 C₁-C₄-烷基),

(I) 上述所示的式(I-1-g)至(I-2-g)化合物, 其中 A、B、L、Q¹、

Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 m 、 R^6 、 R^7 和Het具有上述含义，

可通过上述所示的式(I-1-a)至(I-2-a)化合物，其中A、B、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 m 和Het具有上述含义，分别

(α) 与式(XII)的异氰酸酯或异硫氰酸酯任选在稀释剂存在下和任选在催化剂存在下反应得到



其中

R^6 和L具有上述含义，

或

(β) 与式(XIII)的氨基甲酰氯或硫代氨基甲酰氯任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下反应得到



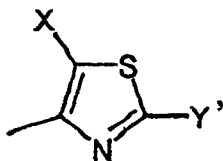
其中

L、 R^6 和 R^7 具有上述含义。

此外，已发现，取决于取代基，新的式(I)化合物作为害虫防治剂，优选作为杀虫剂、杀螨剂、除草剂和杀真菌剂具有很好的活性。

本发明化合物通过式(I)进行一般定义。上述和下述结构式中给出的优选的取代基或范围在下面说明：

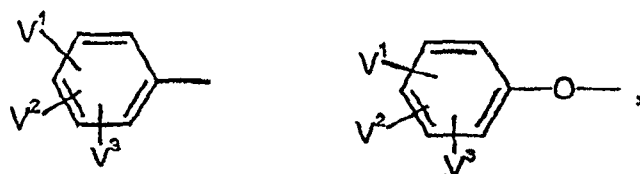
Het 优选表示



m 优选表示数字 0 或 1，

X 优选表示氢、卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_3-C_6 -烯基氧基、硝基或氰基，

Y 优选表示卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基或表示基团



V^1 优选表示氢、卤素、 C_1-C_{12} -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷硫基、 C_1-C_6 -烷基亚硫酰基、 C_1-C_6 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、硝基、氰基或各自任选被卤素、 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、硝基或氰基一或多取代的苯基、苯氧基、苯氧基- C_1-C_4 -烷基、苯基- C_1-C_4 -烷氧基、苯硫基- C_1-C_4 -烷基或苯基- C_1-C_4 -烷硫基，

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

V^1 和 V^2 与和其相连接的碳原子一起优选表示任选被 C_1-C_4 -烷基或卤素取代的 5-或 6-元环，其中任选一或两个碳原子可被氧、硫或氮代替，

A 优选表示氢或各自任选被卤素取代的 C_1-C_{12} -烷基、 C_3-C_8 -烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、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 -环烷基或 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_4 -烷基，其中任选一或两个不相邻的环成员被氧和/或硫替代或表示各自任选被卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、氰基或硝基取代的苯基、苄基、具有 5 或 6 个环原子的杂芳基(例如呋喃基、吡啶基、咪唑基、三唑基、吡唑基、噻唑基、噻吩基)或具有 5 或 6 个环原子的杂芳基- C_1-C_4 -烷基(例如吡啶基- C_1-C_4 -烷基、噻唑基- C_1-C_4 -烷基或噻吩基- C_1-C_4 -烷基)，

B 优选表示氢或 C_1-C_6 -烷基，

A、B 和与其相连接的碳原子一起优选表示饱和的 C_3-C_{10} -环烷基或不饱和的 C_3-C_{10} -环烷基，其中任选一个环成员被氧或硫替代并且其任选被 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_8 -环烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷硫基、卤素或苯基一或二取代，

A 和 Q^1 一起优选表示任选被 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基一或二、相同或不同地取代的 C_3-C_6 -烷二基，

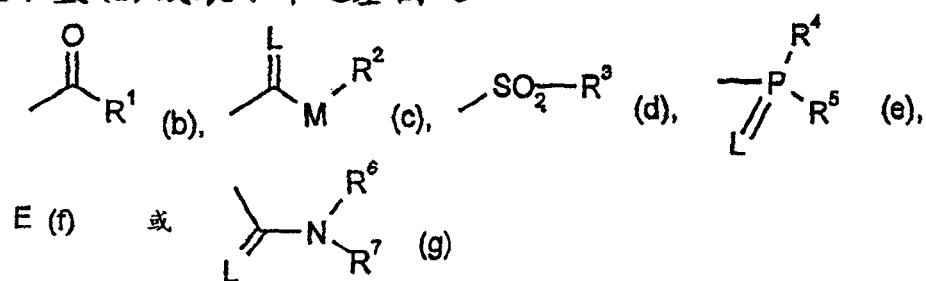
Q^1 优选表示氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_2 -烷基、任选被氟、氯、

C₁-C₄-烷基、C₁-C₂-卤代烷基或 C₁-C₄-烷氧基取代的 C₃-C₈-环烷基，其中任选一个亚甲基被氧或硫替代或各自任选被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₂-卤代烷基、C₁-C₂-卤代烷氧基、氰基或硝基取代的苯基、吡啶基、噻吩基、噻唑基、苯基-C₁-C₄-烷基、吡啶基-C₁-C₂-烷基或噻唑基-C₁-C₂-烷基，

Q²、Q³、Q⁴ 优选相互独立表示氢或 C₁-C₄-烷基，

Q¹ 和 Q² 优选与和其相连的碳原子一起表示任选被 C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基或 C₁-C₂-卤代烷基取代的 C₃-C₇-环烷基，其中任选一个环成员被氧或硫替代，

G 优选表示氢 (a) 或表示下述基团之一



尤其是表示 (a)、(b)、(c) 或 (g)，

其中

E 表示金属离子或铵离子，

L 表示氧或硫，和

M 表示氧或硫，

R¹ 优选表示各自任选被卤素取代的 C₁-C₂₀-烷基、C₂-C₂₀-烯基、C₁-C₈-烷氧基-C₁-C₈-烷基、C₁-C₈-烷硫基-C₁-C₈-烷基、多-C₁-C₈-烷氧基-C₁-C₈-烷基或任选被卤素、C₁-C₆-烷基或 C₁-C₆-烷氧基取代的 C₃-C₈-环烷基，其中任选一或多个 (优选一或两个) 不相邻的环成员被氧和/或硫替代，

表示任选被卤素、氰基、硝基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷硫基或 C₁-C₆-烷基磺酰基取代的苯基，

表示任选被卤素、硝基、氰基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷基或 C₁-C₆-卤代烷氧基取代的苯基-C₁-C₆-烷基，

表示任选被卤素、C₁-C₆-烷基或三氟甲基取代的 5-或 6-元杂芳基

(例如吡唑基、噻唑基、吡啶基、嘧啶基、呋喃基或噻吩基),
表示任选被卤素或 C_1-C_6 -烷基取代的苯氧基- C_1-C_6 -烷基, 或
表示任选被卤素、氨基或 C_1-C_6 -烷基取代的 5-或 6-元杂芳基氧基- C_1-C_6 -烷基 (例如吡啶基氧基- C_1-C_6 -烷基、嘧啶基氧基- C_1-C_6 -烷基或噻唑基氧基- C_1-C_6 -烷基),

R^2 优选表示各自任选被卤素取代的 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、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_2-C_8 -烷基,
表示任选被卤素、 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
表示各自任选被卤素、氟基、硝基、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷基或 C_1-C_6 -卤代烷氧基取代的苯基或苄基,

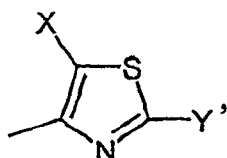
R^3 优选表示任选被卤素取代的 C_1-C_8 -烷基或表示各自任选被卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、氟基或硝基取代的苯基或苄基,

R^4 和 R^5 优选相互独立表示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、 C_2-C_8 -烯基硫基、 C_3-C_7 -环烷基硫基或表示各自任选被卤素、硝基、氟基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -卤代烷硫基、 C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_4 -卤代烷基取代的苯基、苄基、苯氧基或苯硫基,

R^6 和 R^7 相互独立优选表示氢, 表示各自任选被卤素取代的 C_1-C_8 -烷基、 C_3-C_8 -环烷基、 C_1-C_8 -烷氧基、 C_3-C_8 -烯基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基, 表示任选被卤素、 C_1-C_8 -卤代烷基、 C_1-C_8 -烷基或 C_1-C_8 -烷氧基取代的苯基、任选被卤素、 C_1-C_8 -烷基、 C_1-C_8 -卤代烷基或 C_1-C_8 -烷氧基取代的苄基或与和它们连接的氮一起表示任选被 C_1-C_4 -烷基取代的 C_3-C_6 -亚烷基, 其中任选一个碳原子被氧或硫替代。

在作为优选提到的基团定义中, 卤素, 以及取代基, 如在卤代烷基中的卤素表示氟、氯、溴和碘, 尤其是表示氟和氯。

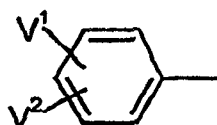
Het 特别优选表示



m 特别优选表示数字 0 或 1,

X 特别优选表示氢、氟、氯、溴或 C_1-C_4 -烷基,

Y 特别优选表示氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基或表示基团



V^1 特别优选表示氢、氟、氯、溴、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_2 -卤代烷基、 C_1-C_2 -卤代烷氧基、硝基、氰基或任选被氟、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、硝基或氰基一或二取代的苯氧基,

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

V^1 和 V^2 和与其相连的碳原子一起特别优选表示任选被氟或甲基取代的 5-或 6-元环, 其中任选一至两个碳原子可被氧替代,

A 特别优选表示氢, 表示各自任选被氟一至三取代的 C_1-C_6 -烷基或 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_2 -烷基, 表示各自任选被氟、氯、甲基、乙基或甲氧基 1 或 2 取代的 C_5-C_6 -环烷基或 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_2 -烷基, 其中任选一个环成员被氧或硫替代或表示各自任选被氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_2 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_2 -卤代烷氧基一至二取代的苯基或苄基,

B 特别优选表示氢或 C_1-C_4 -烷基,

A、B 和与其相连接的碳原子一起特别优选表示饱和的 C_5-C_6 -环烷基, 其中任选一个环成员被氧替代和其任选被 C_1-C_4 -烷基、三氟甲基或 C_1-C_4 -烷氧基单取代,

条件是在这种情况下 Q^1 只代表氢或 C_1-C_4 -烷基,

A 和 Q^1 一起特别优选表示任选被甲基、乙基、甲氧基或乙氧基一或二取代的 C_3-C_4 -烷二基,

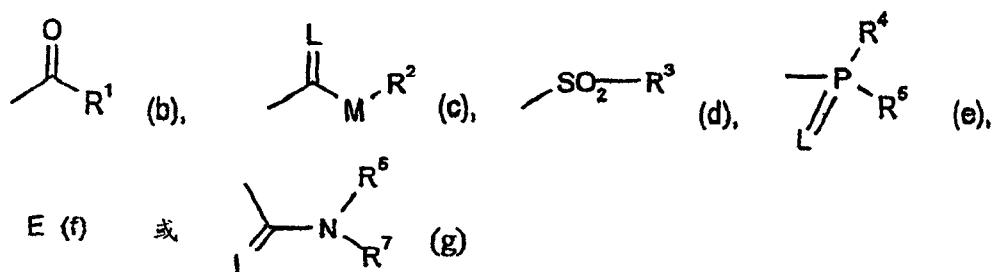
Q^1 特别优选表示氢、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_2 -烷基，或表示任选被甲基或甲氧基取代的 C_3 - C_6 -环烷基，其中任选一个亚甲基被氧替代，或表示各自任选被氟、氯、溴、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、三氟甲基或三氟甲氧基一至二取代的苯基或苄基，

Q^2 、 Q^3 、 Q^4 相互独立特别优选表示氢、甲基或乙基，

Q^1 和 Q^2 特别优选与和其相连的碳原子一起表示任选被 C_1 - C_4 -烷基或 C_1 - C_4 -烷氧基取代的饱和的 C_5 - C_6 -环烷基，其中任选一个环成员被氧替代，

条件是在这种情况下 A 只代表氢或 C_1 - C_4 -烷基

G 特别优选表示氢 (a) 或表示下述基团之一



特别是表示 (a)、(b) 或 (c)，

其中

E 表示金属离子或铵离子，

L 表示氧或硫，和

M 表示氧或硫，

R^1 特别优选表示各自任选被氟或氯一至五取代的 C_1 - C_{16} -烷基、 C_2 - C_{16} -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，或任选被氟、氯、 C_1 - C_4 -烷基或 C_1 - C_5 -烷氧基一至二取代的 C_3 - C_6 -环烷基，其中任选一或两个不相邻的环成员被氧和/或硫替代，

表示任选被氟、氯、溴、氟基、硝基、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、三氟甲基或三氟甲氧基一至二取代的苯基，

表示各自任选被氟、氯、溴、甲基、乙基或三氟甲基单取代的吡啶基或噻吩基，

R^2 特别优选表示 C_1 - C_{16} -烷基、 C_2 - C_{16} -烯基或 C_1 - C_4 -烷氧基- C_2 - C_4 -烷基，表示任选被甲基、乙基或甲氧基一至二取代的 C_3 - C_6 -环烷基，

表示各自任选被氟、氯、溴、氟基、硝基、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷

氧基、三氟甲基或三氟甲氧基一至二取代的苯基或苄基,

R^3 特别优选表示任选被氟一至五取代的 C_1-C_4 -烷基或表示任选被氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氟基或硝基一至二取代的苯基,

R^4 特别优选表示 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, 或表示各自任选被氟、氯、溴、硝基、氧基、 C_1-C_3 -烷氧基、三氟甲氧基、 C_1-C_3 -烷基或三氟甲基一至二取代的苯基、苄基、苯氧基或苯硫基,

R^5 特别优选表示 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -烷硫基,

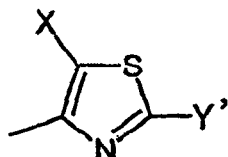
R^6 特别优选表示氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_3-C_6 -烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基, 表示任选被氟、氯、溴、三氟甲基、 C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_4 -烷氧基一至二取代的苯基, 表示任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基或甲氧基取代的苄基,

R^7 特别优选表示氢、 C_1-C_6 -烷基或 C_3-C_6 -烯基,

R^6 和 R^7 与和它们连接的氮原子一起特别优选表示任选被甲基或乙基一至二取代的 C_5-C_6 -亚烷基, 其中任选一个亚甲基被氧或硫替代。

在作为特别优选提到的基团定义中, 卤素, 以及取代基, 如在卤代烷基中的卤素表示氟、氯、溴, 尤其是表示氟和氯, 特别是表示氟。

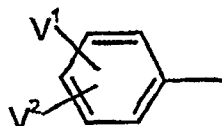
Het 十分特别优选表示



m 十分特别优选表示数字 0 或 1,

X 十分特别优选表示氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基,

Y 十分特别优选表示基团



V^1 十分特别优选表示氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、三氟甲基、三氟甲氧基或 4-氯苯氧基,

V² 十分特别优选表示氢、氟、氯、溴、甲基、甲氧基或三氟甲基,

A 十分特别优选表示氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、苯基或环己基,

B 十分特别优选表示氢、甲基或乙基,

A、B 和与其相连的碳原子一起十分特别优选表示饱和的 C₅-C₆-环烷基, 其中任选一个环成员被氧替代和其任选被甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、正丁氧基或异丁氧基单取代,

条件是, 在这种情况下 Q¹ 仅表示氢,

A 和 Q¹ 一起十分特别优选表示 C₃-C₄-烷二基,

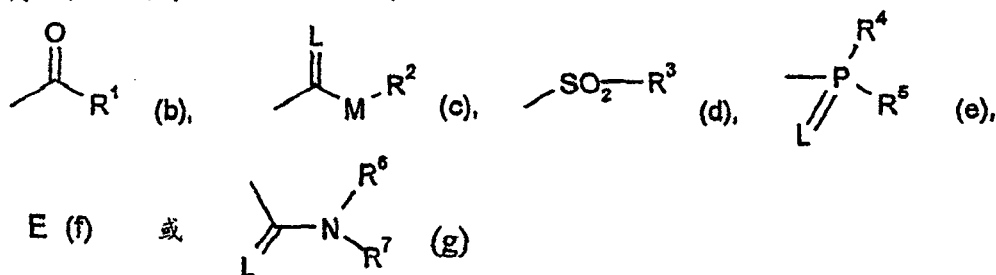
Q¹ 十分特别优选表示氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、环丙基、环戊基、环己基或 4-氯苯基,

Q²、Q³、Q⁴ 相互独立十分特别优选表示氢、甲基或乙基,

Q¹ 和 Q² 与和它们连接的碳原子一起十分特别优选表示任选被甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或正丁氧基取代的饱和的 C₅-C₆-环烷基, 其中任选一个环成员被氧替代,

条件是, 在这种情况下 A 仅表示氢,

G 十分特别优选表示氢(a)或表示下述基团之一



尤其表示(a)、(b)或(c),

其中

E 表示金属离子或铵离子,

L 表示氧或硫, 和

M 表示氧或硫,

R¹ 十分特别优选表示各自任选被氟或氯取代的 C₁-C₃-烷基、C₂-C₃-烯基、C₁-C₂-烷氧基-C₁-C₂-烷基、C₁-C₂-烷硫基-C₁-C₂-烷基或各自任选被氟、氯、甲基、乙基或甲氧基单取代的环丙基或环己基,

表示任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、甲基、乙基、异丙基、叔

丁基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基单取代的苯基,

表示各自任选被氟、氯、溴或甲基单取代的噻吩基或吡啶基,

R^2 十分特别优选表示 C_1-C_3 -烷基、 C_2-C_3 -烯基或 C_1-C_4 -烷氧基- C_2 -烷基,

表示任选被甲基、乙基或甲氧基单取代的 C_3-C_6 -环烷基,

表示各自任选被氟、氯、氟基、硝基、甲基、乙基、异丙基、叔丁基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基单取代的苯基或苄基,

R^3 十分特别优选表示各自任选被氟三取代的甲基或乙基或任选被氟、氯、溴、甲基、叔丁基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氟基或硝基单取代的苯基,

R^4 十分特别优选表示 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷基氨基、二- $(C_1-C_4$ -烷基)氨基、 C_1-C_4 -烷硫基或表示各自任选被氟、氯、溴、硝基、氟基、 C_1-C_2 -烷氧基、三氟甲氧基或 C_1-C_3 -烷基单取代的苯基、苯氧基或苯硫基,

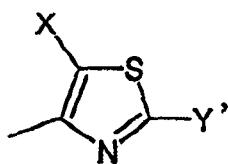
R^5 十分特别优选表示甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、甲硫基或乙硫基,

R^6 十分特别优选表示氢, 表示 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_1-C_4 -烷基,

R^7 十分特别优选表示氢、 C_1-C_4 -烷基或 C_3-C_4 -烯基,

R^6 和 R^7 与和其相连的氮原子一起十分特别优选表示 C_5 -亚烷基, 其中任选一个亚甲基被氧替代。

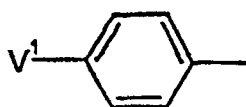
Het 最优选表示



m 最优选表示数字 0 或 1,

X 最优选表示氢、甲基或乙基,

Y 最优选表示基团



V^1 最优选表示氢、氯、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、三氟甲基或表示 4-氯苯氧基,

A 最优选表示氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、苯基或环己基,

B 最优选表示氢、甲基或乙基,

A、B 和与其相连的碳原子一起最优选表示饱和的 C_5-C_6 -环烷基, 其中任选一个环成员被氧替代和其任选被甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、正丁氧基或异丁氧基单取代,

条件是, 在这种情况下 Q^1 仅表示氢,

A 和 Q^1 一起最优选表示 C_3-C_4 -烷二基,

Q^1 最优选表示氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基或 4-氯苯基,

Q^2 最优选表示氢、甲基或乙基,

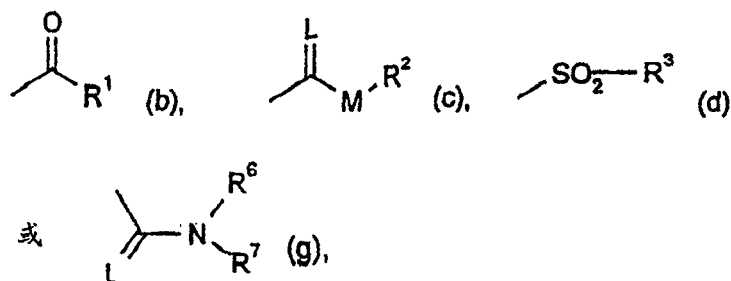
Q^3 最优选表示氢,

Q^4 最优选表示氢,

Q^1 和 Q^2 与和它们连接的碳一起最优选表示饱和的 C_5-C_6 -环烷基,

条件是, 在这种情况下 A 仅表示氢,

G 最优选表示氢 (a) 或表示下述基团之一



其中

L 表示氧, 和

M 表示氧或硫,

R^1 最优选表示 C_1-C_3 -烷基、 C_1-C_2 -烷氧基- C_1-C_2 -烷基或任选被氯单取代的环丙基,

表示任选被氯单取代的苯基,

表示任选被氯单取代的吡啶基,

R^2 最优选表示 C_1-C_3 -烷基,

表示苯基或苄基,

R^3 最优选表示甲基或乙基,

R^6 和 R^7 与和其相连的氮原子一起最优选表示 C_3 -亚烷基, 其中任选一个亚甲基被氧替代。

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

按照本发明, 优选式 (I) 化合物, 其中上述的组合是优选给出的含义的组合。

按照本发明, 特别优选式 (I) 化合物, 其中上述的组合是特别优选给出的含义的组合。

按照本发明, 十分特别优选式 (I) 化合物, 其中上述的组合是十分特别优选给出的含义的组合。

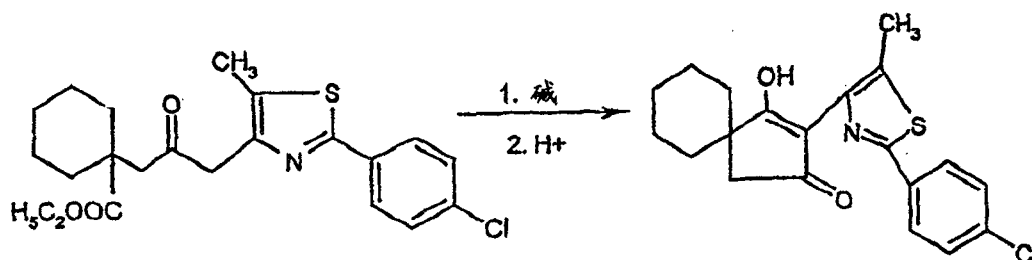
按照本发明, 最优选强 (I) 化合物, 其中上述的组合是最优选给出的含义的组合。

尤其优选其中 G 表示氢的式 (I) 化合物。

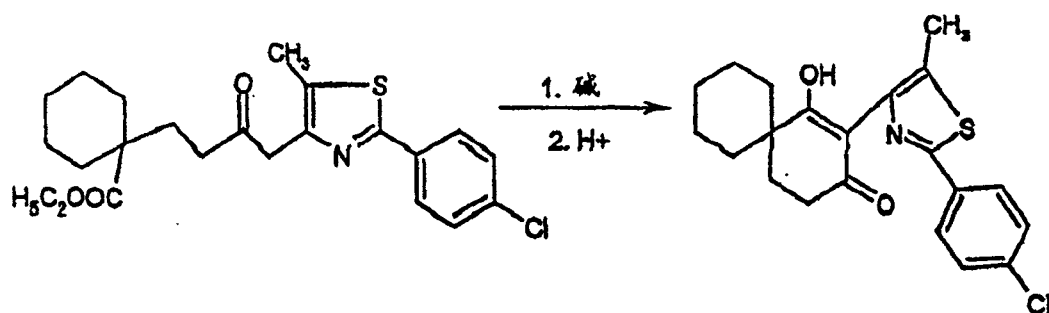
可能的情况下, 饱和的或不饱和的烃基如烷基或烯基, 包括与杂原子连接的情况下, 如在烷氧基中, 可以是直链或支链的。

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

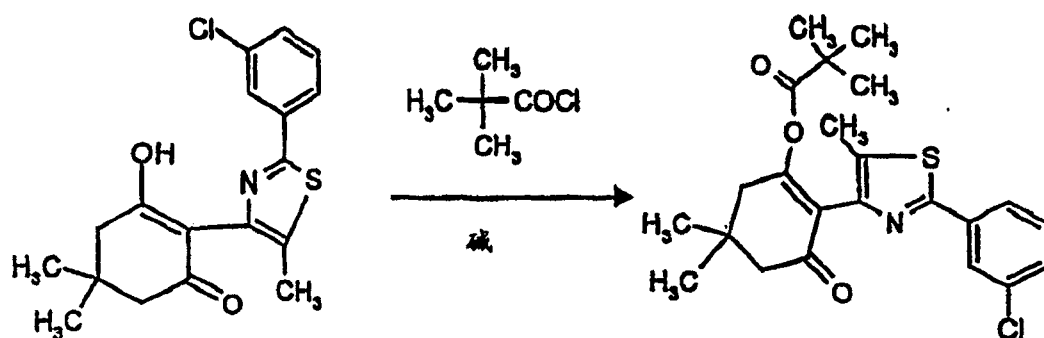
例如按照方法 (A), 如果应用 1-[4-(5-甲基)-2-(4-氯苯基)-噻唑基] 3-(1-乙氧基羰基-环己基)-丙酮作为原料, 那么本发明方法的进程可通过下述反应路线表示:



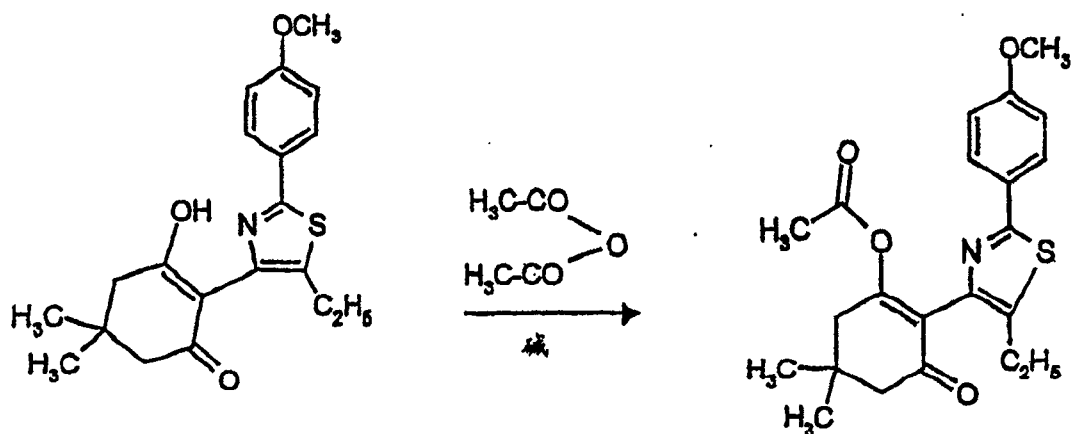
例如按照方法 (B), 如果应用 1-[4-(5-甲基)-2-(4-氯苯基)-噻唑基]-4-(1-乙氧基羰基-环己基)-丁烷-2-酮作为原料, 那么本发明方法的进程可通过下述反应路线表示:



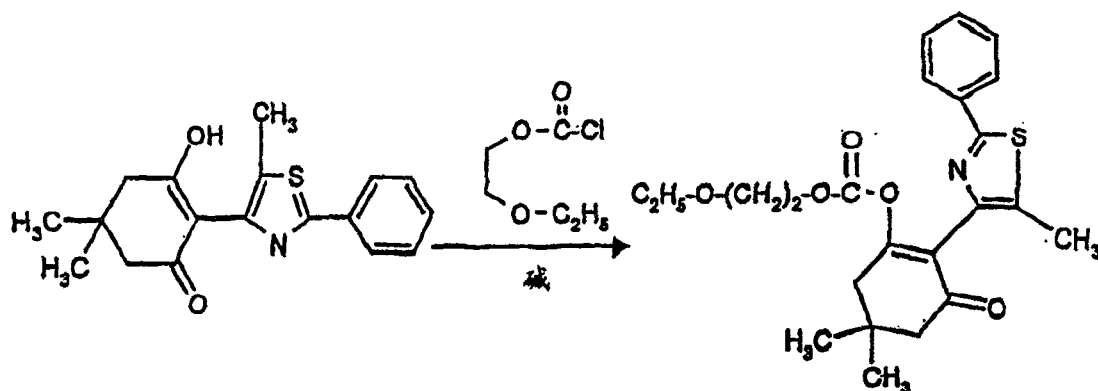
例如按照方法(C_α), 如果应用 2-[4-(5-甲基-2-(3-氯-苯基)-噻唑基)]-5,5-二甲基环己烷-1,3-二酮和新戊酰氯作为原料, 那么本发明方法的进程可通过下述反应路线表示:



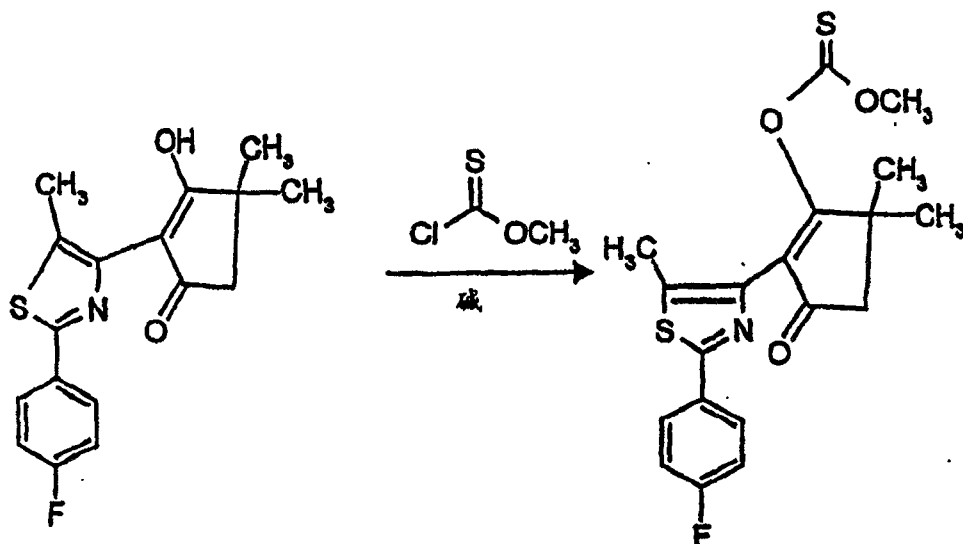
例如按照方法(C_β), 如果应用 2-[4-(5-乙基-2-(4-甲氧基-苯基)-噻唑基)]-5,5-二甲基-环己烷-1,3-二酮和乙酸酐作为原料, 那么本发明方法的进程可通过下述反应路线表示:



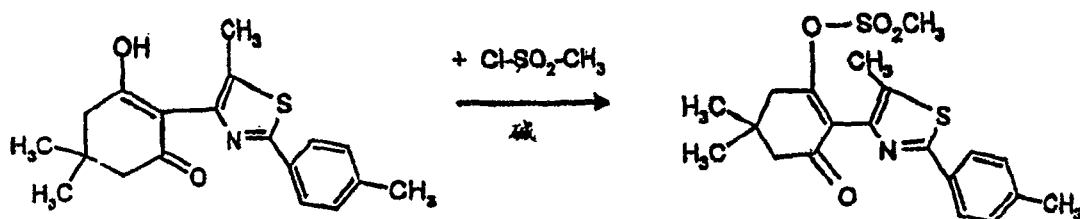
例如按照方法(D), 如果应用 2-[4-(5-甲基-2-苯基)-噻唑基]-5,5-二甲基-环己烷-1,3-二酮和氯甲酸乙氧基乙酯作为原料, 那么本发明方法的进程可通过下述反应路线表示:



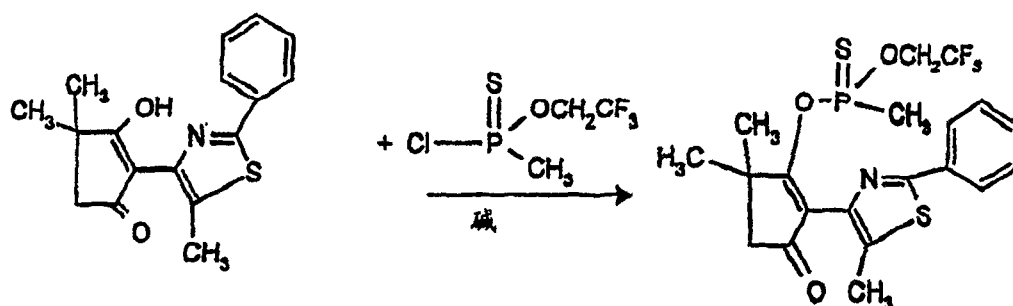
例如按照方法(E)，如果应用 2-[4-(5-甲基-2-(4-氟-苯基))-噻唑基]-4,4-二甲基-环戊烷-1,3-二酮和氯一硫代甲酸甲酯作为原料，那么该反应进程可通过下述反应路线表示：



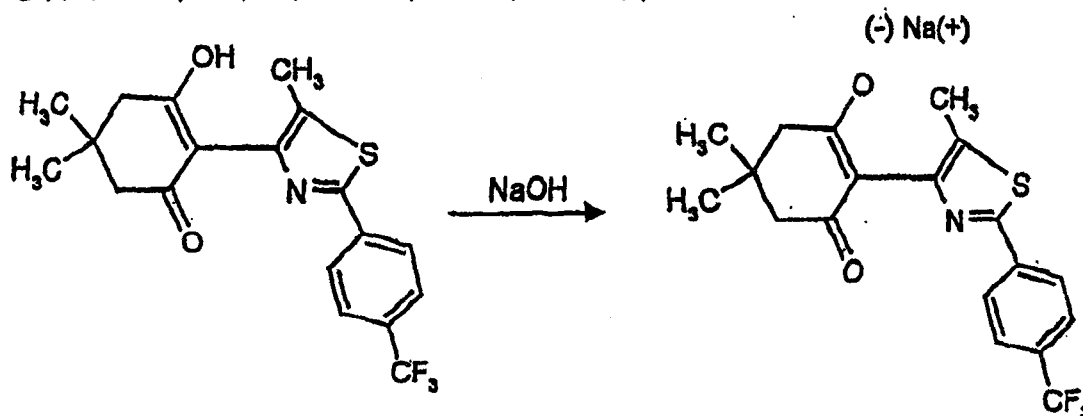
例如按照方法(F)，如果应用 2-[4-(5-甲基-3-(4-甲基-苯基)-噻唑基)]-5,5-二甲基-环己烷-1,3-二酮和甲磺酰氯作为原料，那么该反应进程可通过下述反应路线表示：



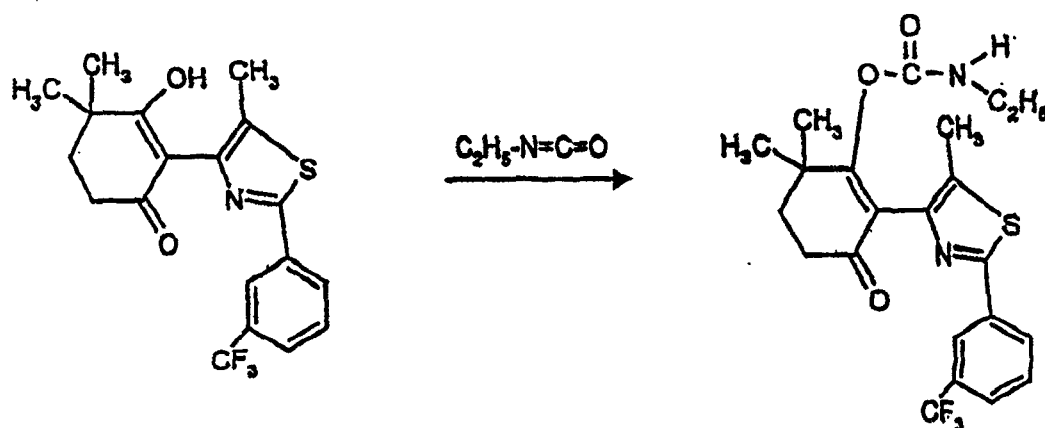
例如按照方法(G)，如果应用 2-[4-(5-甲基-2-苯基)-噻唑基]-4,4-二甲基-环戊烷-1,3-二酮和甲烷硫代磷酰氯-(2,2,2-三氟乙酯)作为原料，那么该反应进程可通过下述反应路线表示：



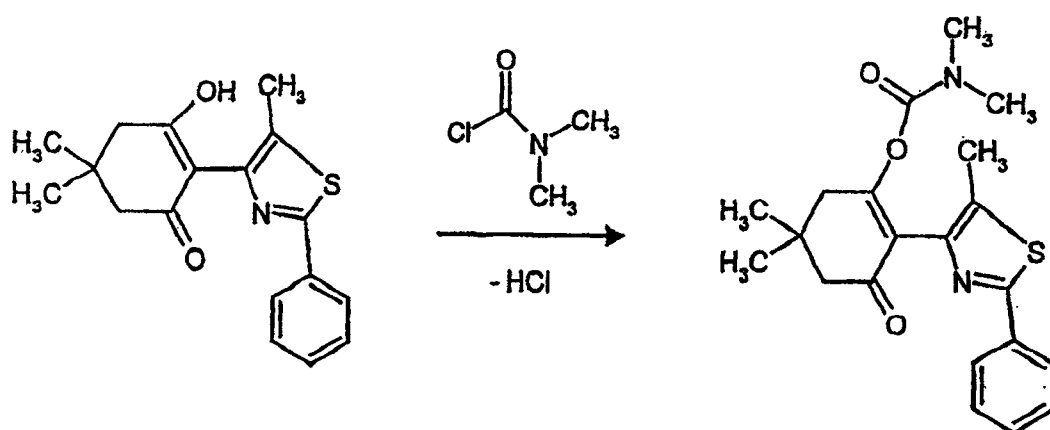
例如按照方法(H)，如果应用 2-[4-(5-甲基-2-(4-三氟甲基-苯基))-噻唑基]-5,5-二甲基-环己烷-1,3-二酮和 NaOH 作为原料，那么本发明方法的进程可通过下述反应路线表示：



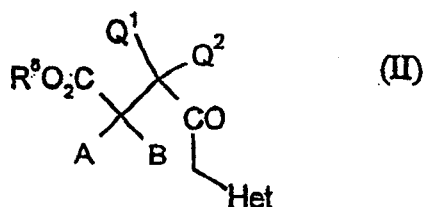
例如按照方法(I α)，如果应用 2-[4-(5-甲基-2-(3-三氟甲基-苯基))-噻唑基]-4,4-二甲基-环己烷-1,3-二酮和异氰酸乙酯作为原料，那么该反应进程可通过下述反应路线表示：



例如按照方法(I β)，如果应用 2-[4-(5-甲基-2-苯基)-噻唑基]-5,5-二甲基-环己基-1,3-二酮和二甲基氨基甲酰氯作为原料，那么该反应进程可通过下述反应路线表示：



在上述方法 (A) 中作为原料需要的式 (II) 酮酸酯

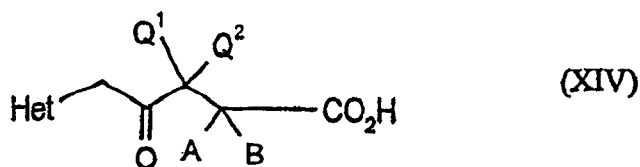


其中

A、B、Het、Q¹、Q² 和 R⁸ 具有上述含义，
是新化合物。

它们可通过原则上已知的方法制备。

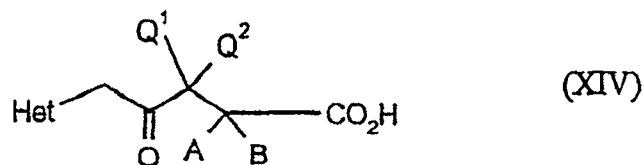
式 (II) 的 5-杂芳基-4-酮酸酯例如通过式 (XIV) 的 5-杂芳基-4-酮酸酯化 (参见例如 Organikum, 15. Auflage, Berlin, 1977, 第 499 页) 或烷基化 (参见制备实例) 得到



其中

A、B、Het、Q¹ 和 Q² 具有上述含义。

式 (XIV) 的 5-杂芳基-4-酮酸

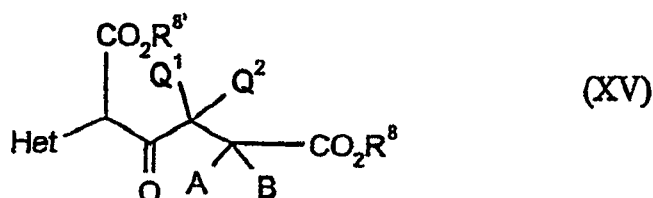


其中

A、B、Het、Q¹和Q²具有上述含义，

是新化合物，但也可按照原则上已知的方法制备(参见制备实施例)。

式(XIV)的5-杂芳基-4-酮酸例如通过式(XV)的2-杂芳基-3-氧代-己二酸酯



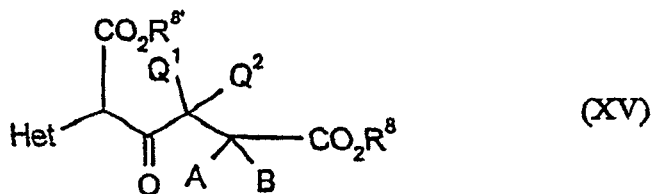
其中

A、B、Het、Q¹和Q²具有上述含义，和

R⁸和R^{8'}表示烷基(尤其是C₁-C₈-烷基)，

任选在稀释剂存在下和任选在碱或酸存在下脱羧得到(参见 z. B. Organikum, 15. Auflage, Berlin, 1977, 第 519 至 521 页)。

式(XV)化合物



其中

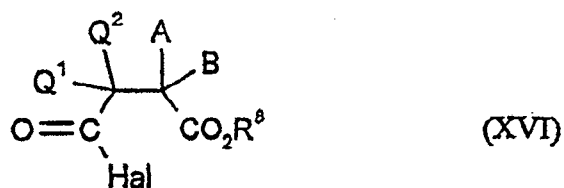
A、B、Het、Q¹、Q²、R⁸和R^{8'}具有上述含义，

或者如果应用式(XVII)化合物作为原料用于制备，

和R⁸表示氢

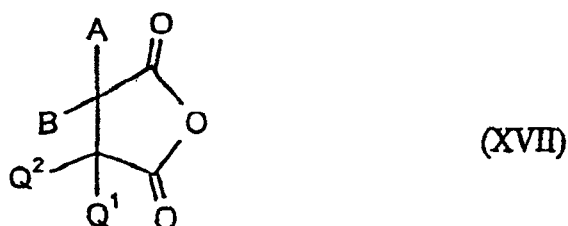
是新化合物。

式(XV)化合物，例如通过式(XVI)的二羧酸半酯酰氯



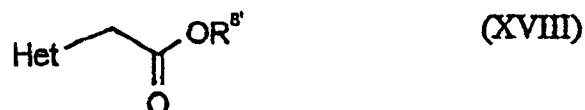
其中

A、B、Q¹、Q²和R⁸具有上述含义，和
Hal表示氯或溴，
或者式(XVII)的羧酸酐



其中

A、B、Q¹和Q²具有上述含义，
与式(XVIII)的杂芳基乙酸酯



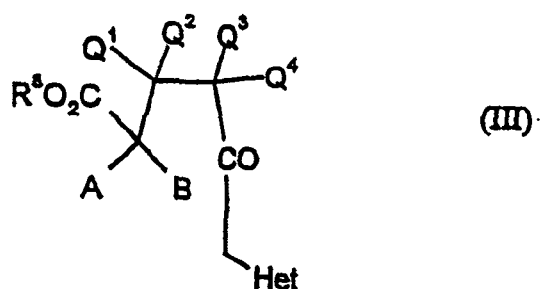
其中

Het和R⁸具有上述含义，

在稀释剂存在下和任选在碱存在下酰化得到(参见例如 M. S. Chambers, E. J. Thomas, D. J. Williams, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228, 也参见制备实施例)。

式(XVI)和(XVII)的化合物一部分是有机化学中已知的化合物和/或可按照原则上已知的方法通过简单的方式制备。

在上述方法(B)中作为原料需要的式(III)的酮酸酯

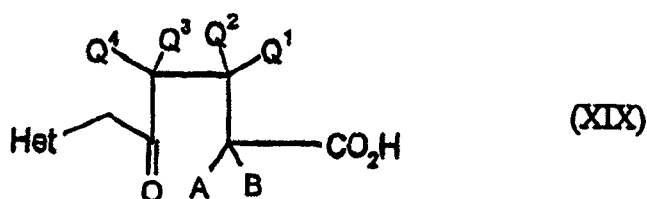


其中

A、B、Het、Q¹、Q²、Q³、Q⁴和R⁵具有上述含义，
是新化合物。

这些化合物可通过原则上已知的方法制备。

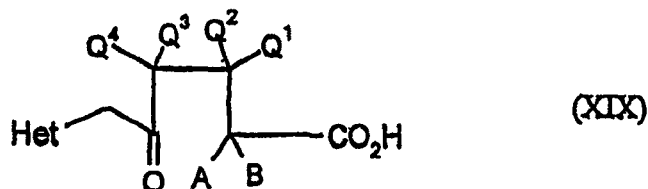
例如式(III)的 6-杂芳基-5-酮酸酯可通过式(XIX)的 6-杂芳基-5-酮酸



其中

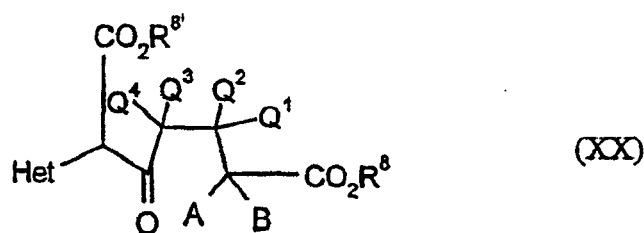
A、B、Het、Q¹、Q²、Q³和Q⁴具有上述含义，
酯化得到(参见例如 Organikum, 15. Auflage, Berlin, 1977, 第499页)。

式(XIX)的 6-杂芳基-5-酮酸



其中

A、B、Het、Q¹、Q²、Q³和Q⁴具有上述含义，
是新化合物。这些化合物可通过原则上已知的方法制备，例如通过式(XI)被取代的 2-杂芳基-3-氧代-庚二酸酯



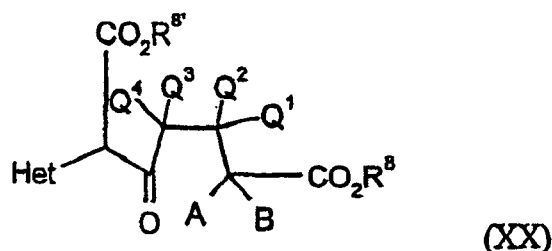
其中

A、B、Het、Q¹、Q²、Q³和Q⁴具有上述含义，和

R⁸和R^{8'}表示烷基(优选C₁-C₆-烷基)，

任选在稀释剂存在下和任选在碱或酸存在下皂化和脱羧得到(参见例如 Organikum, 15. Auflage, Berlin, 1977, 第519至521页)。

式(XX)化合物

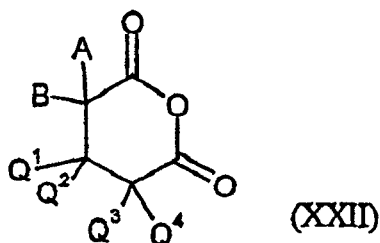
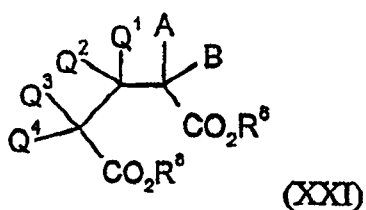


其中

A、B、Het、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、R⁸和R^{8'}具有上述含义，

或者当式(XXII)化合物作为原料用于制备时，并且R⁸表示氢是新化合物。

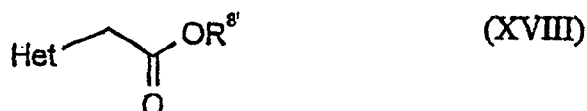
式(XX)化合物例如可通过式(XXI)的二羧酸酯或者式(XXII)的二羧酸酐



其中

A、B、Q¹、Q²、Q³、Q⁴和R⁸具有上述含义，

与式(XVIII)被取代的杂芳基乙酸酯



其中

Het 和 $\text{R}^{8'}$ 具有上述含义,

在稀释剂存在下和任选在碱存在下缩合得到。

式 (XXI) 和 (XXII) 化合物部分可商购, 部分是已知的和/或可通过已知的方法制备。

式 (XVIII) 化合物部分是新化合物, 但可通过原则上已知的方法制备:

1. C. S. Rooney 等. J. Med. Chem. 1983, 26, 700-714.
2. M. S. Malamas 等. J. Med. Chem. 1996, 39, 237-245.
3. J. L. Collins 等. J. Med. Chem. 1998, 41, 5037-5054.
4. EP-A-0 177 353.
5. EP-A-0 368 592.
6. NL-A-6614130.

此外, 用于实施本发明方法 (C)、(D)、(E)、(F)、(G)、(H) 和 (I) 作为原料需要的式 (IV) 的酰卤、式 (V) 的酸酐、式 (VI) 的氯甲酸酯或氯甲酸硫代酯、式 (VII) 的氯一硫代甲酸酯或氯二硫代甲酸酯、式 (VIII) 的磺酰氯、式 (IX) 的磷化合物和式 (X) 和 (XI) 的金属氢氧化物、金属烷氧化物或胺和式 (XII) 的异氰酸酯和式 (XIII) 的氨基甲酰氯或硫代氨基甲酰氯一般是有机或无机化学已知的化合物。

式 (XVI)、(XVII) 和 (XXI) 化合物部分可商购, 部分为已知的和/或可通过原则上已知的方法制备。

方法 (A) 的特征在于, 式 (II) 化合物, 其中 A、B、 Q^1 、 Q^2 、Het 和 R^8 具有上述含义, 任选在碱存在下进行分子内缩合。

在本发明方法 (A) 中作为稀释剂可应用所有惰性有机溶剂。优选可应用烃类, 如甲苯和二甲苯, 醚类, 如二丁基醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲基醚和二乙二醇二甲基醚, 以及极性溶剂, 如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺和 N-甲基-吡咯烷酮, 以及醇类如甲醇, 乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

在实施本发明方法 (A) 中作为碱(去质子化剂)可应用所有常规质

子接受体。优选可应用碱金属-和碱土金属氧化物、-氢氧化物和-碳酸盐，如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙，它们也可在应用相转移催化剂的情况下应用。所述相转移催化剂如氯化三乙基苄基铵、溴化四丁基铵、Adogen 464 (= 氯化甲基三烷基(C₈-C₁₀)铵)或TDA 1 (= 三-(甲氧基乙氧基乙基)-胺)。此外，可应用碱金属，如钠或钾。此外是碱金属-和碱土金属氮化物和-氢化物，如氮化钠、氮化钾和氮化钙，也可应用碱金属醇化物，如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

在实施本发明方法(A)中的反应温度可在较大范围内变化。一般情况下反应温度为-80℃至180℃，优选为-50℃至120℃。

本发明方法(A)一般在常压下进行。

在实施本发明方法(A)中，一般加入式(II)的反应组分和约两倍等摩尔量的去质子的碱。但是，也可以过量应用一种或其它组分(高达3摩尔)。

方法(B)的特征在于，式(III)化合物，其中A、B、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Het和R⁸具有上述含义，在稀释剂存在下和任选在碱存在下进行分子内缩合。

在本发明方法(B)中作为稀释剂可应用所有惰性有机溶剂。优选可应用烃类，如甲苯和二甲苯，醚类，如二丁基醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲基醚和二乙二醇二甲基醚，以及极性溶剂，如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和N-甲基-吡咯烷酮，以及醇类如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

在实施本发明方法(B)中作为碱(去质子化剂)可应用所有常规质子接受体。优选可应用碱金属-和碱土金属氧化物、-氢氧化物和-碳酸盐，如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙，它们也可在应用相转移催化剂的情况下应用。所述相转移催化剂如氯化三乙基苄基铵、溴化四丁基铵、Adogen 464 (= 氯化甲基三烷基(C₈-C₁₀)铵)或TDA 1 (= 三-(甲氧基乙氧基乙基)-胺)。此外，可应用碱金属，如钠或钾。此外是碱金属-和碱土金属氮化物和-氢化物，如氮化钠、氮化钾和氮化钙，也可应用碱金属醇化物，如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

在实施本发明方法(B)中的反应温度可在较大范围内变化。一般

情况下反应温度为 -80°C 至 180°C ，优选为 -50°C 至 120°C 。

本发明方法(B)一般在常压下进行。

在实施本发明方法(B)中，一般加入约等摩尔量的式(III)的反应组分和去质子的碱。但是，也可以过量应用一种或其它组分(高达3摩尔)。

方法(C- α)的特征在于，式(I-1-a)至(I-2-a)的化合物分别与式(IV)的酰卤任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下反应。

在本发明方法(C- α)中作为稀释剂可应用所有对酰卤惰性的溶剂。优选可应用烃类，如汽油，苯，甲苯，二甲苯和1,2,3,4-四氢化萘，以及卤代烃类，如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、氯苯和邻二氯苯，此外是酮类，如丙酮和甲基异丙基酮，以及醚类，如乙醚、四氢呋喃和二噁烷，以及羧酸酯类，如乙酸乙酯，腈类如乙腈和强极性溶剂，如二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺、二甲基亚砷和环丁砷。如果所述酰卤的水解稳定性允许，也可在水存在下进行反应。

在按照本发明方法(C- α)的反应中作为酸结合剂可以是所有常规的酸接受体。优选可应用叔胺，如三乙胺、吡啶、二氮杂二环辛烷(DABCO)、二氮杂二环十一碳烯(DBU)、二氮杂二环壬烯(DBN)、Hünig-碱和N,N-二甲基-苯胺，以及碱土金属氧化物，如氧化镁和氧化钙，以及碱金属-和碱土金属碳酸盐，如碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙以及碱金属氢氧化物，如氢氧化钠和氢氧化钾。

实施本发明方法(C- α)的反应温度可在较大范围内变化，一般情况下反应温度为 -20°C 至 $+150^{\circ}\text{C}$ ，优选为 0°C 至 100°C 。

在实施本发明方法(C- α)中，式(I-1-a)至(I-2-a)的原料和式(IV)的酰卤一般以接近等摩尔量应用。但是，也可以应用较大过量的酰卤(高达5摩尔)。后处理按常规方法进行。

方法(C- β)的特征在于，式(I-1-a)至(I-2-a)化合物与式(V)的酸酐任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下反应。

在本发明方法(C- β)中优选应用与在应用酰卤时优选应用的相同的稀释剂。此外，也可应用过量的酰卤而同时起到稀释剂的作用。

在本发明方法(C- β)中任选加入的酸结合剂可与在应用酰卤时优选应用的酸结合剂相同。

本发明方法(C- β)的反应温度可在较大范围内变化，一般情况下反

应温度为 -20°C 至 $+150^{\circ}\text{C}$ ，优选为 0°C 至 100°C 。

在实施本发明方法(C- β)中，一般应用近等当量的式(I-1-a)至(I-2-a)化合物和式(V)的酸酐。但是，也可以较大的过量应用酸酐(高达5摩尔)。后处理按常规方法进行。

一般通过蒸馏或通过用有机溶剂或用水洗涤除去稀释剂和过量存在的酸酐。

方法(D)的特征在于，式(I-1-a)至(I-2-a)化合物分别与式(VI)的氯甲酸酯或氯甲酸硫醇酯任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下反应。

在实施本发明方法(D)的反应中，作为酸结合剂可应用所有常规的酸接受体。优选可应用叔胺，如三乙胺、吡啶、DABCO、DBU、DBA、Hünig-碱和N,N-二甲基-苯胺，此外是碱土金属氧化物，如氧化镁和氧化钙，碱金属-和碱土金属碳酸盐，如碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙以及碱金属氢氧化物如氢氧化钠和氢氧化钾。

在实施本发明方法(D)中，作为稀释剂可应用所有对氯甲酸酯或氯甲酸硫醇酯呈惰性的溶剂。优选可应用烃类，如汽油、苯、甲苯、二甲苯和1,2,3,4-四氢化萘，卤代烃类，如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、氯苯和邻二氯苯、酮类，如丙酮和甲基异丙基酮，醚类，如乙醚、四氢呋喃和二噁烷，羧酸酯类，如乙酸乙酯，腈类如乙腈和强极性溶剂，如二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺、二甲基亚砷和环丁砷。

实施本发明方法(D)的反应温度可在较大范围内变化。如果在稀释剂和酸结合剂存在下进行，那么反应温度一般为 -20°C 至 $+100^{\circ}\text{C}$ ，优选为 0°C 至 50°C 。

本发明方法(D)一般在常压下进行。

在实施本发明方法(D)中，一般应用近等当量的式(I-1-a)至(I-2-a)的原料和式(VI)相应的氯甲酸酯或氯甲酸硫醇酯。但也可较大过量(高达2摩尔地)应用一种或其它组分。后处理按常规方法进行。一般除去沉淀的盐并通过蒸馏稀释剂浓缩反应混合物。

本发明方法(E)的特征在于，式(I-1-a)至(I-2-a)的化合物分别与式(VII)化合物在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下反应。

在制备方法(E)中，每摩尔式(I-1-a)至(I-2-a)的原料化合物与约1摩尔式(VII)的氯一硫代甲酸酯或氯二硫代甲酸酯在 0 至 120°C ，

优选在 20 至 60℃ 下反应。

作为任选加入的稀释剂可以是所有惰性极性有机溶剂，如腈类、酯类、醚类、酰胺类、砜类、亚砜类以及卤代烷烃类。

优选应用乙腈、乙酸乙酯、二甲亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺或二氯甲烷。

在一种优选实施方案中，如果通过加入强去质子化剂如氢氧化钠或叔丁醇钾制备化合物 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的烯醇盐，那么可以不加其它的酸结合剂。

如果应用酸结合剂，那么可加入常规无机或有机碱，例如可提及氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、吡啶、三乙胺。

该反应可在常压下或高压下进行，优选在常压下进行。后处理按常规方法进行。

本发明方法 (F) 的特征在于，式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物分别与式 (VIII) 的磺酰氯任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下反应。

在制备方法 (F) 中，每摩尔式 (I-1-a 至 I-2-a) 的原料化合物与约 1 摩尔式 (VIII) 的磺酰氯在 -20 至 150℃，优选在 20 至 70℃ 下反应。

作为任选加入的稀释剂可以是所有惰性极性有机溶剂，如腈类、酯类、醚类、酰胺类、砜类、亚砜类以及卤代烷烃类如二氯甲烷。

优选应用乙腈、乙酸乙酯、二甲基亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺或二氯甲烷。

在一种优选实施方案中，如果通过加入强去质子化剂 (如氢氧化钠或叔丁醇钾) 制备化合物 (I-1-a) 至 (I-2-a) 的烯醇盐，那么可以不加其它的酸结合剂。

如果应用酸结合剂，那么可加入常规无机或有机碱，例如可提及氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、吡啶、三乙胺。

该反应可在常压下或高压下进行，优选在常压下进行。后处理按常规方法进行。

本发明方法 (G) 的特征在于，式 (I-1-a) 至 (I-2-a) 化合物分别与式 (IX) 的磷化合物任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下反应。

在制备方法 (G) 中，为了得到式 (I-1-e) 至 (I-2-e) 化合物，使 1 摩

尔(I-1-a)至(I-2-a)化合物与1至2, 优选1至1.3摩尔式(IX)的磷化合物在-40℃至150℃, 优选在-10至110℃温度下反应。

作为任选加入的稀释剂可以是所有惰性极性有机溶剂, 如醚类、酰胺类、腈类、醇类、硫醚、砜类、亚砜类等。

优选应用乙腈、二甲亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺、二氯甲烷。

作为任选加入的酸结合剂可以是所有无机或有机碱, 例如可提及如氢氧化物、碳酸盐或胺类。例如氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、吡啶、三乙胺。

该反应可在常压下或高压下进行, 优选在常压下进行。后处理按常规有机化学方法进行。沉淀出的终产物的纯化优选通过结晶, 色谱纯化或者通过所谓的“初始蒸馏(Andestillieren)”, 即在真空下除去挥发性组分。

方法(H)的特征在于, 式(I-1-a)至(I-2-a)化合物与式(X)的金属氢氧化物或金属烷氧化物或式(XI)的胺, 任选在稀释剂存在下反应。

在本发明该方法中, 作为稀释剂可优选应用醚类如四氢呋喃、二噁烷、乙醚或醇类如甲醇、乙醇、异丙醇或水。

本发明方法(H)一般在常压下进行。

反应温度一般为-20℃至100℃, 优选为0℃至50℃。

本发明方法(I)的特征在于, 式(I-1-a)至(I-2-a)的化合物分别

(I-α): 与式(XII)的化合物任选在稀释剂存在下和任选在催化剂存在下, 或

(I-β): 与式(XIII)的化合物任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下反应。

在制备方法(I-α)中, 每摩尔式(I-1-a)至(I-2-a)的原料化合物与约1摩尔式(XII)的异氰酸酯在0至100℃, 优选在20至50℃温度下反应。

作为任选应用的稀释剂可以是所有惰性有机溶剂, 如醚类、酰胺类、腈类、砜类、亚砜类。

可任选加入催化剂以加快反应。作为催化剂可应用很有利的锡有机化合物, 如二月桂酸二丁基锡。优选在常压下进行。

在制备方法(I-β)中, 每摩尔式(I-1-a)至(I-2-a)的化合物与约1摩尔式(XIII)的氨基甲酰氯在-20至150℃, 优选在0至70℃温度下

反应。

作为任选加入的稀释剂可以是所有惰性极性有机溶剂，如腈类、酯类、醚类、酰胺类、砜类、亚砜类或卤代的烃类。

优选应用乙腈、乙酸乙酯、二甲亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺或二氯甲烷。

在一种优选实施方案中，如果通过加入强去质子化剂如氢氧化钠或叔丁醇钾制备化合物(I-1-a)至(I-2-a)的烯醇盐，那么可以不加其它的酸结合剂。

本发明活性化合物适于控制动物害虫，特别是在农业、林业、储藏产品和材料的保护，以及卫生领域中发生的昆虫、蜘蛛类动物和线虫，同时具有很好的植物耐受性以及对抗温动物的可接受的毒性。它们可优选用作植物保护剂。它们对正常敏感和抗性种类以及对所有或某些发育阶段具有活性。上述害虫包括：

等足目，例如，潮虫(*Oniscus asellus*)、平甲虫、鼠妇。

倍足目，例如，具斑马陆。

唇足目，例如，食果地蜈蚣、蚰蜒属。

综合目，例如，庭园么蚰。

缨尾目，例如，台湾衣鱼。

弹尾目，例如，武装棘跳虫。

直翅目，例如，家蟋蟀、蝼蛄属、非洲飞蝗、黑蝗属、沙漠蝗。

蜚蠊目，例如，东方蜚蠊、美洲大蠊、马得拉蜚蠊、德国小蠊。

革翅目，例如，欧洲球螋。

等翅目，例如，散白蚁属。

虱目，例如，体虱、血虱属、颚虱属、嚼虱属、盲虱属。

缨翅目，例如，温室条蓟马、烟蓟马、棕榈蓟马、苜蓿蓟马。

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

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

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

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

膜翅目,例如,松叶蜂属、实叶蜂属、毛蚁属、小家蚁、胡蜂属。

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

蚤目,例如,印鼠客蚤、角叶蚤属。

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

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

本发明化合物在一定的浓度或用量下还可任选用作除草剂和杀微生物剂,例如用作杀真菌剂、抗霉菌剂和杀细菌剂。如需要,还可以作为合成其它活性化合物的中间体或前体。

根据本发明,可以处理所有植物和植物部分。此处植物可以理解所有植物以及植物群落如需要和不需要的野生植物或农作物(包括自然长出的农作物)。农作物可以是通过常规植物育种和优化方法或通过生物技术和重组方法或上述方法的结合获得的植物,包括转基因植物以及包括可获得或不能获得植物品种保护的植物品种,植物的部分应理解为植物的所有地上和地下部分以及器官,如茎、叶、花和根,可提及的实例为叶片、针叶、叶柄、树干、花、子实体、果实、种子、根、块茎和根状茎。植物各部分还包括收获材料以及无性和有性繁殖材料,例如插条、块茎、根状茎、压枝和种子。

采用活性化合物进行植物和植物部分的本发明处理方法是通过常规处理方法直接施用或将化合物作用于它们的环境、栖息地或贮藏区进行处理,例如浸渍、喷雾、熏蒸、弥雾、撒播、刷涂以及在繁殖材料特别是种子的情况下还可以进行一层或多层包衣。

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

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

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

适合的固体载体有:

例如,铵盐和天然矿物粉末,如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、硅镁土、蒙脱土或硅藻土,和合成矿物粉末,如高分散二氧化硅、氧化铝和硅酸盐;适合颗粒剂的固体载体有:例如,粉碎和分级的天然岩石,如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石,以及合成的无机和有机粉末颗粒,以及有机材料的颗粒如锯末、坚果壳、玉米穗茎和烟草茎;

适合的乳化剂和/或发泡剂有：例如非离子和阴离子乳化剂，如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚，例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐以及蛋白水解产物；

适合的分散剂有：例如木素亚硫酸废液和甲基纤维素。

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

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

制剂中通常含有按重量计0.1-95%，优选0.5-90%的活性化合物。

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

作为混合组分例如可考虑如下化合物：

杀真菌剂：

Aldimorph, 氯丙腈酸、氯丙腈酸钾、Andoprim、敌菌灵、戊环唑、腈嘧菌酯，

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

石硫合剂、Capsimycin、敌菌丹、克菌丹、多菌灵、萎锈灵、Carvon、灭螨锰、灭瘟唑、苯咪唑菌、地茂散、氯化苦、百菌清、乙菌利、Clozylacon、硫杂灵、清菌脲、环唑醇、环丙嘧啶、酯菌胺，

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

克瘟散、氧唑菌、乙环唑、乙菌定、氯唑灵，

噁唑酮菌、菌拿灵、异嘧菌醇、腈苯唑、呋菌胺、种衣酯、拌种咯、苯锈定、丁苯吗啉、薯瘟锡、毒菌锡、福美铁、嘧菌脲、氟定胺、

氟联苯菌 (Flumetover)、氟菌安、喹唑菌酮、调密醇、氟硅唑、磺菌胺、氟酰胺、粉唑胺、灭菌丹、藻菌磷 (Fosetyl-Aluminium)、藻菌磷 (Fosetyl-Natrium)、四氯苯酞、麦穗宁、呋氨丙灵、呋吡唑灵、灭菌安 (Furcarbonil)、呋菌唑、呋醚唑、拌种胺、双胍盐、六氯苯、己唑醇、噁霉灵,

烯菌灵、酰胺唑、双胍辛 (Iminoctadin)、双胍辛对十二烷基苯磺酸盐 (Iminoctadinealbesilate)、双胍辛醋酸盐、Iodocarb、环戊唑醇、异稻瘟脞 (IBP)、异丙定、Irumamycin、富士一号、氯苯咪菌酮,

春雷霉素、亚胺菌、铜制品, 如, 氢氧化铜、环烷酸铜、氯氧化铜、硫酸铜、氧化铜、喹啉铜、和碱式硫酸铜混合物,

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

福美镍、异丙消、氯苯嘧啶醇,

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

多效唑、稻瘟酯、戊菌唑、戊菌隆、双氯苯磷、多马霉素、Picoxystrobin、粉病灵、多氧霉素、Ployoxorim、噻菌灵、丙氧灵、杀菌利、百维灵、Propanosine-Natrium、丙环唑、甲基代森锌、Pyraclostrobin、定菌磷、啉斑脞、二甲嘧菌胺、咯嗪酮、氯吡呋醚, 唑嗪菌酮、五氯硝基苯 (PCNB),

硫和硫制剂,

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

烯效唑,

有效霉素、烯菌酮、烯霜芽唑,

氟菌胺、代森锌、福美锌以及

咪草酯 G、OK-8705、OK-8801,

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

醇,

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

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

α -(5-甲基-1,3-二噁烷-5-基)- β -[[4-(三氟甲基)-苯基]-亚甲基]-1H-1,2,4-三唑-1-乙醇,

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

(E)- α -(甲氧基亚氨基)-N-甲基-2-苯氧基-苯基乙酰胺,

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

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

1-(2-甲基-1-萘基)-1H-吡咯-2,5-二酮,

1-(3,5-二氯苯基)-3-(2-丙烯基)-2,5-吡咯烷二酮,

1-[(二碘甲基)-磺酰基]-4-甲基-苯,

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

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

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

1-甲基-5-壬基-2-(苯基甲基)-3-吡咯烷醇 (pyrrolidinol),

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

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

2,6-二氯-5-(甲基硫基)-4-嘧啶基硫氰酸酯,

2,6-二氯-N-(4-三氟甲基苄基)-苯甲酰胺,

2,6-二氯-N-[[4-(三氟甲基)-苯基]-甲基]-苯甲酰胺,

2-(2,3,3-三碘-2-丙烯基)-2H-四唑,

2-[(1-甲基乙基)-磺酰基]-5-(三氟甲基)-1,3,4-噻二唑,

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

2-氨基丁烷,
2-溴-2-(溴甲基)-戊烷二腈,
2-氯-N-(2,3-二氢-1,1,3-三甲基-1H-茚-4-基)-3-吡啶甲酰胺
2-氯-N-(2,6-二甲基苯基)-N-(异硫氰酸根合甲基)-乙酰胺,
2-苯基苯酚(OPP),
3,4-二氯-1-[4-(二氟甲氧基)-苯基]-1H-吡咯-2,5-二酮,
3,5-二氯-N-[氰基[(1-甲基-2-丙炔基)-氧基]-甲基]-苯甲酰胺,
3-(1,1-二甲基丙基-1-氧代-1H-茚-2-腈),
3-[2-(4-氯苯基)-5-乙氧基-3-异噁唑烷基]-吡啶,
4-氯-2-氰基-N,N-二甲基-5-(4-甲基苯基)-1H-咪唑-1-磺酰胺,
4-甲基-四唑并[1,5-a]喹唑啉-5(4H)-酮,
8-(1,1-二甲基乙基)-N-乙基-N-丙基-1,4-二氧杂螺[4.5]癸烷-2-甲胺,
8-羟基喹啉硫酸盐,
9H-咕吨-9-甲酸-2-[(苯基氨基)-羰基]-酰肼,
双-(1-甲基乙基)-3-甲基-4-[(3-甲基苯甲酰基)-氧基]-2,5-噻吩二甲酸酯,
顺-1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-环庚醇,
顺-4-[3-[4-(1,1-二甲基丙基)-苯基-2-甲基丙基]-2,6-二甲基-吗啉]盐酸盐,
[(4-氯苯基)-偶氮]-氰基乙酸乙酯,
碳酸氢钾,
甲烷四硫醇钠盐,
1-(2,3-二氢-2,2-二甲基-1H-茚-1-基)-1H-咪唑-5-甲酸甲酯,
N-(2,6-二甲基苯基)-N-(5-异噁唑基羰基)-DL-丙氨酸甲酯,
N-(氯乙酰基)-N-(2,6-二甲基苯基)-DL-丙氨酸甲酯,
N-(2,3-二氯-4-羟基苯基)-1-甲基-环己烷甲酰胺,
N-(2,6-二甲基苯基)-2-甲氧基-N-(四氢-2-氧代-3-咪唑基)-乙酰胺,
N-(2,6-二甲基苯基)-2-甲氧基-N-(四氢-2-氧代-3-噻吩基)-乙

酰胺,

N-(2-氯-4-硝基苯基)-4-甲基-3-硝基-苯磺酰胺,

N-(4-环己基苯基)-1,4,5,6-四氢-2-嘧啶胺,

N-(4-己基苯基)-1,4,5,6-四氢-2-嘧啶胺,

N-(5-氯-2-甲基苯基)-2-甲氧基-N-(2-氧代-3-噁唑烷基)-乙酰胺,

N-(6-甲氧基)-3-吡啶基-环丙烷甲酰胺,

N-[2,2,2-三氯-1-[(氯乙酰基)-氨基]-乙基]-苯甲酰胺,

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

N-甲酰基-N-羟基-DL-丙氨酸-钠盐,

0,0-二乙基-[2-(二丙基氨基)-2-氧代乙基]-乙基硫代氨基磷酸酯(ethylphosphoramidothioat)

0-甲基-S-苯基-苯基丙基硫代氨基磷酸酯,

1,2,3-苯并噻二唑-7-硫代羧酸 S-甲酯,

螺[2H]-1-苯并吡喃-2,1'(3'H)-异苯并呋喃]-3'-酮,

4-[(3,4-二甲氧基苯基)-3-(4-氯苯基)-丙烯酰基]-吗啉

杀菌剂:

溴硝丙二醇、双氯酚、氯定、福美镍、春雷霉素、异噻菌酮、呋喃甲酸、土霉素、噻菌灵、链霉素、叶枯酞、硫酸铜和其它铜制剂。

杀虫剂/杀螨剂/杀线虫剂:

阿维菌素、乙酰甲胺磷、啉虫脒、氯丙菊酯、棉铃威、涕灭威、涕灭砒威、甲体氯氰菊酯(Alphacypermethrin)、甲体氯氰菊酯(Alphamethrin)、双甲脒、齐墩螨素、AZ 60541、艾扎丁、甲基吡啶磷、谷硫磷 A、谷硫磷 M、三唑锡,

波林杆菌芽孢、Bacillus sphaericus、柯敌克菌、苏金杆菌、Baculoviruses、Beauveria bassiana、Beauveria tenella、噁虫威、丙硫克百威、杀虫磺、苯螨特、 β -氯氯氰菊酯、联苯肼酯、联苯菊酯、Bioethanomethrin、生物氯菊酯、Bistrifluron、BPMC、溴硫磷 A、合杀威、噻嗪酮、特密硫磷、丁酮威、丁基吡啶灵(Butylpyridaben)、

硫线磷、甲萘威、克百威、三硫磷、丁硫克百威、杀螟丹、

Chloethocarb、氯氧磷、氟唑虫清、毒虫畏、氟啶脲、氯甲硫磷、毒死蜱、毒死蜱 M、Chlovaporthrin、Chromafenozide、顺式灭虫菊 (Cis-Resmethrin)、Cispermethrin、Cloocythrin、除线威、四螨嗪、Clothianidine、杀螟腈、Cycloprene、乙氧菊酯、氟氟氟菊酯、氟氟氟菊酯、三环锡、氟氟菊酯、灭蝇胺,

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

Eflusilanate、Emamectin、右旋烯炔菊酯、硫丹、Entomopftthora spp.、高氟戊菊酯、苯虫威、乙硫磷、灭克磷、醚菊酯、特苯噁唑、氧嘧啶磷、

克线磷、喹螨醚、杀螨锡、杀螟硫磷、苯硫威、Fenoxacrim、双氧威、甲氧菊酯、Fenpyrad、Fenpyrithrin、唑螨酯、杀灭菊酯、锐劲特、氟啶胺、氟啶蜉脲、Flubrocycythrinate、氟蜉脲、氟氟戊菊酯、氟虫脲、氟氟苯菊酯、Flutenzine、氟胺氟菊酯、地虫磷、丁苯硫磷、噻唑酮磷、Fubfenprox、呋线威、

颗粒层增殖病毒、

特丁苯酞肼、HCH、庚虫磷、氟铃脲、噻螨酮、烯虫乙酯、

吡虫啉、噁二唑虫、氟唑磷、丙胺磷、异噁唑磷、齐墩螨素、

核多角体病毒、

氟氟氟菊酯、氟丙氧脲、

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

二溴磷、硝胺烯啶、硝虫噻嗪、双苯氟脲、

氧乐果、甲胺叉威、砒吸磷、

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

喹噁磷,

Ribavirin,

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

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

蚜灭多、氟吡唑虫、麦柯特尔,

YI 5302,

Zeta-cypermethrin、Zolaprofos,

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

2, 2, 3, 3-四甲基环丙烷甲酸[(3-苯氧基苯基)-甲基]酯,

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]四氢-3, 5-二甲基-N-硝基-1, 3, 5-三嗪-2(1H)-亚胺,

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

2-(乙酰基氧基)-3-十二烷基-1, 4-萘二酮,

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

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

丙基氨基甲酸(3-甲基苯基)酯,

4-[4-(4-乙氧基苯基)-4-甲基戊基]-1-氟-2-苯氧基-苯,

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

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

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

苏云金杆菌菌株 EG-2348,
苯甲酸[2-苯甲酰基-1-(1,1-二甲基乙基)-酰肼],
丁酸[2,2-二甲基-3-(2,4-二氯苯基)-2-氧代-1-氧杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基]酯,
[3-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-噻唑烷亚基]-氨基氰,
二氢-2-(硝基亚甲基)-2H-1,3-噻嗪-3(4H)-甲醛,
[2-[[1,6-二氢-6-氧代-1-(苯基甲基)-4-哒嗪基]氧基]乙基]-氨基甲酸乙酯,
N-(3,4,4-三氟-1-氧代-3-丁烯基)-甘氨酸,
N-(4-氯苯基)-3-[4-(二氟甲氧基)苯基]-4,5-二氢-4-苯基-1H-吡唑-1-甲酰胺,
N-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-N'-甲基-N''-硝基-胍,
N-甲基-N'-(1-甲基-2-丙烯基)-1,2-胍二硫代甲酰胺,
N-甲基-N'-2-丙烯基-1,2-胍二硫代甲酰胺,
O,O-二乙基-[2-(二丙基氨基)-2-氧代乙基]-乙基硫代氨基磷酸酯,
N-氟基甲基-4-三氟甲基-烟酰胺
3,5-二氯-1-(3,3-二氯-2-丙烯基氧基)-4-[3-(5-三氟甲基吡啶-2-基氧基)-丙氧基]-苯。

与其它已知活性化合物例如除草剂或肥料以及生长调节剂的混合物也是可能的。

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

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

以适用于应用形式的常规方法进行使用。

当用于防治卫生害虫和储藏物品中的害虫时,活性化合物具有优良的木材和粘土残留活性以及对刷有石灰的基底具有很好的碱稳定性。

如上所提及,可按照本发明处理所有植物及其部分。在一个优选

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

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

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

属于按照本发明优选进行处理的转基因植物或植物品种(即通过基因工程得到的那些)包括通过基因材料的基因工程修饰得到的所有植物,所述基因修饰赋予这些植物特别有利的有用的性能(“特性”)。这种性能的例子是较好的植物生长、增强对高或低温的耐受性、增强对旱灾或水灾或土壤盐量的耐受性、增加花卉的性能、易于收获、加速成熟、较高的收获产量、收获产品较好的质量和/或较高的营养价值、收获产品较好的储存稳定性和/或可加工性。进一步和特别强调的所述性能的例子是提高植物对动物和微生物的害虫,如昆虫、螨、植物病菌真菌、细菌和/或病毒的抵御性,以及提高植物对某些除草活性化合物的耐受性。可提及的转基因植物的例子是重要的农作物,如谷类农作物(小麦、稻)、玉米、大豆、土豆、棉花、油菜籽油菜和水果植物(水果为苹果、梨、柑橘属水果和葡萄),特别强调的是玉米、大豆、土豆、棉花和油菜籽油菜。特别强调的特性是通过在植物中产生的毒素,特别是通过来自 *Thuringiensis* 杆菌的基因物质(例如通过基因 CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、

Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb 和 CryIF 及它们的联合) (下文称作“Bt 植物”) 在植物中产生的那些增强植物对昆虫的抵御。还特别需要强调的特性是提高通过系统获得的抗性(SAR)、系统素(Systemin)、植物抗毒素、Elicitorin 和抗性基因以及相应表达的蛋白和毒素来抗真菌、细菌和毒素的植物防护作用。此外, 特别强调的特性是植物对某些除草活性化合物, 如咪唑啉酮类、磺酰脲类、草甘膦类或膦基麦黄酮(例如“PAT”基因)的增强的耐受性。给予所述的需要的特性的基因也可以在转基因植物中相互联合存在。可提及的“Bt 植物”的例子是以商标名 YIELD GARD®(例如玉米、棉花、大豆)、KnockOut®(例如玉米)、StarLink®(例如玉米)、Bollgard®(棉花)、Nucotn®(棉花)和 Newleaf®(土豆)出售的玉米品种、棉花品种、大豆品种和土豆品种。可提及的耐受除草剂的植物是以商标名 Roundup Ready®(耐受草甘膦, 例如玉米、棉花、大豆)、Liberty Link®(耐受膦基麦黄酮, 例如油菜籽油菜)、IMI®(耐受咪唑啉酮类)和 STS®(耐受磺酰脲类, 例如玉米)出售的玉米品种、棉花品种、大豆品种。可提及的耐除草剂的植物(以常规方式除草剂耐受育种)包括以商标名 Clearfield®(例如玉米)出售的品种。当然, 这些叙述也适用于具有所述特性或将来还要改良的基因特性的将来开发的植物或将来投放市场的植物品种。

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

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

虱目, 例如, 血虱属、颚虱属、虱属、Pthirus spp.、管虱属;

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

双翅目以及长角亚目和短角亚目, 例如, 伊蚊属、按蚊属、库蚊属、蚋属、真蚋属、白蛉属、Lutzomyia spp.、库蠓属、斑虻属、瘤虻属、

黄虻属、虻属、麻翅虻属、*Philipomyia* spp.、蜂虻属、家蝇属、齿股蝇属、螫蝇属、角蝇属、莫蝇属、厕蝇属、舌蝇属、丽蝇属、绿蝇属、金蝇属、*Wohlfahrtia* spp.、麻蝇属、狂蝇属、皮蝇属、胃蝇属、虱蝇属、*Lipoptena* spp.、婢蝇属;

蚤目,例如,蚤属、栉首蚤属、印鼠客蚤属、角叶蚤属;

异翅亚目,例如,臭虫属、椎猎蝽属、红腹猎蝽属、全圆蝽属;

蜚蠊目,例如,东方蜚蠊、美洲大蠊、德国小蠊、蜚蠊属;

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

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

本发明的式(I)活性化合物也适用于防治侵扰农业家畜的节肢动物,所述农业家畜如牛、绵羊、山羊、马、猪、驴、骆驼、水牛、兔、鸡、火鸡、鸭、鹅、蜜蜂,其它家养动物,例如狗、猫、笼养鸟、水族馆的鱼,还有所谓的试验动物,例如田鼠、豚鼠、大鼠和小鼠。通过防治上述节肢动物,旨在减少动物死亡和减产(肉、奶、毛、皮、蛋、蜜等)的情况,因此,通过使用本发明的式(I)活性化合物可以使畜牧业管理更经济而简便。

应用于兽医领域时,本发明式(I)活性化合物可通过已知方法即经肠给药,例如以片剂、胶囊剂、饮剂、灌药剂、颗粒剂、膏剂、大丸剂、喂食方法、栓剂等形式给药;非经肠给药,例如通过注射(肌肉注射、皮下注射、静脉注射、腹膜内注射等),植入法给药;经鼻给药;经皮肤给药,例如以浸泡或药浴、喷雾、泼浇、擦、洗刷、撒粉方式给药,也可借助于含有活性化合物的成型制品,例如项圈、耳饰物、尾饰物、肢环(带)、笼头、装饰器具等给药。

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

另外,发现本发明活性化合物还对损坏工业材料的昆虫具有很强的杀虫活性。

作为实例并优选列出下述昆虫,但并不限于此:

鞘翅目昆虫,如

北美家天牛、绿虎天牛(*Chlorophorus pilosis*)、家具窃蠹、报死材窃蠹、类翼窃蠹、*Dendrobium pertinex*、松芽枝窃蠹、松产品窃蠹(*Priobium carpini*)、褐粉蠹、粉蠹(*Lyctus africanus*)、南方粉蠹、栎粉蠹、粉蠹(*Lyctus pubescens*)、胸粉蠹(*Trogoxylon aequale*)、鳞毛粉蠹、材小蠹属、条木小蠹属、咖啡黑长蠹、*Bostrychus capucins*、褐异翅长蠹、棘长蠹属、竹竿粉长蠹。

革翅目,例如

蓝黑树蜂、云杉大树蜂、泰加大树蜂、大树蜂(*Urocerus augur*)。

白蚁,例如

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

缨尾目,例如台湾衣鱼。

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

木材以及木制品是特别需要优选保护使其免受昆虫侵袭的材料。

可用本发明组合物或含有本发明组合物的混合物保护的木材和木制品可以理解为表示,例如:

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

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

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

用于保护木材和木制品的杀虫组合物或浓缩物中包括0.0001至95重量%,特别是0.001至60重量%浓度的本发明活性化合物。

组合物或浓缩物的使用量是根据昆虫的种类和个体密度以及介质而确定的。最佳施用量各自可在应用时通过系列试验确定。然而基于需保护的材料,通常使用0.0001至20重量%,优选0.001至10重量%的活性化合物是足够的。

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

优选使用的有机化学溶剂是油性或油类溶剂,其蒸发值大于35以及闪点大于30℃,并优选大于45℃。用作上述低挥发度以及不溶于水的油性和油类溶剂物质是相应的矿物油或它们的芳族馏分,或含有矿物油的溶剂混合物,优选石油溶剂、石油和/或烷基苯。

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

在一个优选实施方案中,使用沸程为180-210℃的液体脂族烃或沸程为180-220℃的芳族和脂族烃的高沸程混合物和/或锭子油和/或一氯代萘,优选 α -一氯代萘。

蒸发值大于35以及闪点大于30℃并优选大于45℃的低挥发度的有机油性或油类溶剂可用易挥发或中挥发度的有机溶剂部分替换,条件是溶剂混合物的蒸发值同样大于35以及闪点大于30℃并优选大于45℃,以及该杀虫剂-杀菌剂混合物可溶或可乳化于上述溶剂混合物中。

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

本发明使用的有机化学粘合剂是合成树脂和/或粘合干性油,它们本身已知可用水稀释和/或可溶解或分散或乳化于上述使用的有机化学溶剂中,特别是由下列物质组成的或包含下列物质的粘合剂丙烯酸树脂、乙烯基树脂,例如聚乙酸乙烯酯、聚酯类树脂、缩聚或加聚树脂、聚氨酯树脂、醇酸树脂或改性的醇酸树脂、酚醛树脂、烃类树脂,如茛/香豆酮树脂、有机硅树脂、干性植物油和/或干性油和/或基于天然和

/或合成树脂的物理干性粘合剂。

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

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

上述粘合剂可全部或部分被固定剂(混合物)或增塑剂(混合物)替代。加入这些添加剂的目的是防止活性化合物的蒸发以及结晶或沉淀。它们优选替代0.01至30%的粘合剂(以使用的粘合剂为100%计)。

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

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

其它适用的溶剂或稀释剂特别是水,任选与一种或多种上述有机化学溶剂或稀释剂、乳化剂和分散剂混合使用。

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

现用制剂还可任选包含其它的杀虫剂和任选其它的一种或多种杀菌剂。

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

十分特别优选的共混组分可以是杀虫剂,如毒死蜱、腈肟磷、灭虫硅醚(Silafloofin)、甲体氟氰菊酯、氟氰菊酯、氟氰菊酯、溴氟菊酯、氟菊酯、吡虫啉、NI-25、氟虫脲、氟铃脲、四氟菊酯、噻虫啉、Methoxyphenoxid 和杀虫隆,

以及杀菌剂,如 Epoxyconazole、己唑醇、戊环唑、丙环唑、戊唑醇、环唑醇、环戊唑菌、烯菌灵、抑菌灵、对甲抑菌灵、3-碘-2-丙

炔基-丁基氨基甲酸酯、N-辛基-异噻唑啉-3-酮和 4,5-二氯-N-辛基-异噻唑啉-3-酮。

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

由于定居性寡毛纲目,如龙介虫科以及甲壳类和Ledamorpha(茗荷儿)类,如各种茗荷属和铠茗荷属,或藤壶亚目(藤壶虫),如藤壶属或指茗荷属的附着增加了船体的摩擦阻力并由于增加了能源消耗以及此外经常滞留于船坞,这样明显增加了运营成本。

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

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

通过使用本发明的活性化合物本身或者与其它活性物质组合,可以不使用重金属,如,例如硫化二(三烷基锡)、月桂酸三正丁基锡、氯化三正丁基锡、氧化亚铜、氯化三乙基锡、三正丁基(2-苯基-4-氯苯氧基)-锡、氧化三丁基锡、二硫化钼、氧化铈、聚合钛酸丁酯、苯基-(联吡啶)-三氯化铋、氯化三正丁基锡、亚乙基二硫代氨基甲酸锰、二甲基二硫代氨基甲酸锌、亚乙基双硫代氨基甲酸锌、2-吡啶硫醇-1-氧化物的锌和铜盐、双二甲基二硫代氨基甲酸亚乙基双硫代氨基甲酸锌、氧化锌、亚乙基双二硫代氨基甲酸亚铜、硫氰酸铜、环烷酸铜和卤化三丁基锡,或显著降低上述化合物浓度。

即用防污漆还可任选包含其它活性化合物,优选杀藻剂、杀菌剂、除草剂、杀软体动物剂或其它防污活性化合物。

下列组分优选用于本发明防污组合物的混合组分:

杀藻剂,如

2-叔丁基氨基-4-环丙基氨基-6-甲硫基-1,3,5-三嗪、双氯酚、敌草隆、草藻灭、醋酸三苯基锡、异丙隆、噻唑隆、乙氧氟草醚、灭藻醌和特丁净,

杀菌剂,如

苯并[b]噻吩甲酸环己基酰胺-S,S-二氧化物、抑菌灵、Fluorfolpet、3-碘-2-丙炔基丁基氨基甲酸酯、对甲抑菌灵和唑类,

如戊环唑、环唑醇、氧唑菌、己唑醇、环戊唑菌、丙环唑和戊唑醇;

杀软体动物剂,如

醋酸三苯基锡、四聚乙醛、灭虫威、贝螺杀、硫双威和混杀威;

或常用防污活性化合物,如

4,5-二氯-2-辛基-4-异噻唑啉-3-酮、二碘甲基paratryl砒、2-(N,N-二甲基硫代氨基甲酰基硫基)-5-硝基噻唑基、2-吡啶硫醇-1-氧化物的钾、铜、钠和锌盐、吡啶三苯基硼烷、四丁基二锡氧烷、2,3,5,6-四氯-4-(甲磺酰基)-吡啶、2,4,5,6-四氯间苯二腈、二硫化四甲基秋兰姆和2,4,6-三氯苯基马来酰亚胺。

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

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

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

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

涂料中还任选可包含优选不溶于海水的无机颜料、有机颜料或染料。涂料中还可包括如松香类物质,以使活性化合物可控制地释放。此外,涂料中可以包含增塑剂,影响流变性质的改良剂,以及其它常规组分。还可以将本发明化合物或上述混合物加入自抛光防污体系中。

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

蝎目,例如钳蝎(*Buthus occitanus*)。

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

蛛形目,例如鸟蛤蛛科、园蛛科。

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

等足目,例如潮虫、鼠妇。

倍足目,例如具斑马陆、山蛩虫属。

唇足目,例如地蜈蚣属。

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

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

跳跃亚目,例如家蟀。

革翅目,例如欧洲球螋。

等翅目,例如木白蚁属、散白蚁属。

啮虫目,例如*Lepinatus*属、粉啮虫属。

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

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

鳞翅目,例如小蜡螟、蜡螟、印度古斑螟、谷蛾、袋谷蛾、幕谷蛾。

蚤目,例如犬栉首蚤、猫栉首蚤指名亚种、人蚤、穿皮潜蚤、印鼠客蚤。

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

虱目,例如头虱、体虱、阴虱。

异翅亚目,例如热带臭虫、温带臭虫、长红猎蝽、侵扰锥猎蝽。

在家用杀虫剂领域的应用通过它们本身或者与其它合适的活性物

质,如磷酸酯类、氨基甲酸酯类、拟除虫菊酯类、生长调节剂类或其它已知杀虫剂类的活性化合物联合进行。

它们可以如下述使用:气溶胶,非增压喷雾剂,例如泵喷雾、喷洒喷雾、烟雾发生器、浓雾、泡沫、凝胶、带有纤维素或聚合物制成的蒸发片的蒸发产品、液体蒸发器、凝胶和薄膜蒸发器、推进式蒸发器、不需能量或被动式蒸发系统、捕蛀虫纸、捕蛾袋和捕虫胶、作为颗粒剂或粉剂、在撒布饵料中或饵料位置。

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

本发明活性化合物可用于例如下列植物:

以下各属的双子叶杂草:苘麻属、苋属、豕草属、Anoda、春黄菊属、Aphanes、滨藜属、雏菊属、鬼针草属、芥属、飞廉属、决明属、矢车菊属、藜属、薊属、旋花属、曼陀罗属、金钱草属、刺酸模属、糖芥属、大戟属、鮡瓣花属、牛膝菊属、猪殃殃属、木槿属、番薯属、地肤属、夜芝麻属、独行菜属、母草属、母菊属、薄荷属、山稔属、羊鱼属(Mullugo)、勿忘草属、罂粟属、牵牛属、车前属、蓼属、马齿苋属、毛茛属、萝卜属、焊菜属、水松叶属、酸模属、猪毛菜属、千里光属、田菁属、黄花稔属、芸苔属、茄属、苦苣菜属、尖瓣花属、繁缕属、蒲公英属、遏蓝菜属、三叶草属、苧麻属、婆婆纳属、堇菜属、苍耳属。

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

以下各属的单子叶杂草:山羊草属、冰草属、翦股颖属、看麦娘属、Apera、燕麦属、臂形草属、雀麦属、蒺藜草属、鸭跖草属、狗牙根属、莎草属、龙爪茅属、马唐属、稗属、荸荠属、蟋蟀草属、画眉草属、野黍属、羊茅属、飘拂草属、异蕊花属、白茅属、鸭嘴草属、千斤子属、毒麦属、两久花属、黍属、雀稗属、鹧草属、梯牧草属、早熟禾属、筒轴茅属、慈菇属、厂草属、狗尾草属、蜀黍属。

以下各属的单子叶农作物:葱属、菠萝属、天门冬属、燕麦属、

大麦属、稻属、黍属、甘蔗属、黑麦属、高粱属、黑小麦属、小麦属、玉蜀黍属。

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

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

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

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

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

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

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

适合的固体载体有：

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

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

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

制剂中通常含有按重量计 0.1-95%,优选 0.5-90%的活性化合物。

为了控制杂草,本发明的活性化合物本身或在其制剂中,还可以与已知的除草剂和/或改善与农作物相容性的物质(防护剂)的混合物的形式使用,可以是最终的制剂或贮罐混合物的形式。另一种可能是与含有一种或多种已知除草剂和防护剂的除草剂的混合物。

对于这些混合物适合的是已知的除草剂,例如:

乙草胺、氟羧草醚(-钠盐)、苯草醚、甲草胺、枯杀达(-钠盐)、莠灭净、Amicarbazone、先甲草胺、磺氨黄隆、莎稗磷、黄草灵、莠去津、唑啶炔草、四唑黄隆、Beflubutamid、草除灵(-乙酯)、吡草黄、苄嘧磺隆(-甲酯)、灭草松、Benzfendizone、Benzobicyclon、吡草酮、新燕灵(-乙酯)、双丙氨酰膦、治草醚、双嘧苯甲酸(-钠盐)、溴丁酰草胺、杀草全、溴苯腈、丁草胺、Butafenacil (-allyl)、丁氧环酮、苏达灭、Cafenstrole、酞肟草、长杀草、氟酮唑草(-乙酯)、氟硝醚、灭草平、杀草敏、氟嘧黄隆(-乙酯)、草枯醚、氟磺隆、氟麦隆、Cinidon (-ethyl)、环庚草醚、醚磺隆、Clefoxydim、烯草酮、炔草酯(-炔丙酯)、异恶草酮、稗草胺、二氯吡啶酸、Clopyrasulfuron

(-methyl)、唑嘧磺胺(-盐)、Cumyluron、草净津、Cybutryne、草灭特、环丙磺隆、噻草酮、Cyhalofop(-butyl)、2,4-D、2,4-DB、异苯敌草、燕麦敌、麦草畏、(高-)2,4-滴丙酸、氟甲草(-甲酯)、唑嘧磺胺、安塔(-乙酯)、野燕枯、吡氟草胺、二氟吡隆、丁噁隆、吡草丹、克草胺、戊草津、噻吩草胺、Dimexyflam、敌乐胺、草乃敌、敌草快、氟硫草定、敌草隆、香草隆、Epropodan、EPTC、禾草畏、丁氟消草、胺苯黄隆(-甲酯)、乙呋草黄、Ethoxyfen、乙氧嘧磺隆、Etobenzanid、(高-)噁唑禾草灵、Fentrazamide、氟燕灵(-异丙酯、-异丙酯-L、-甲酯)、啉嘧磺隆、氟鼠灵、(精-)吡氟禾草灵、Fluazolate、Flucarbazone(-sodium)、Flufenacet、氟唑啉草、酰亚胺苯氧乙酸(-戊酯)、氟噁嗪酮、Flumipropyn、氟唑啉草、氟草隆、氟咯草酮、乙羧氟草隆(-乙酯)、胺草唑、Flupropacil、氟啉磺隆(-甲酯、-钠盐)、抑草丁(-丁酯)、氟草同、氟草烟丁氧异丙酯、氟氯胺啉、调噻醇、呋草酮、达草氟(-甲酯)、Fluthiamide、氟磺胺草醚、Foramsulfuron、草铵膦(-铵盐)、草甘膦(-异丙基铵)、氟硝磺酰胺、吡氟氯禾灵(-乙氧基乙酯、-p-甲酯)、六嗪同、咪草酸(-甲酯)、Imazamethapyr、咪草啉酸、Imazapic、灭草烟、灭草嗪、咪草烟、啉咪磺隆、Iodosulfuron (-methyl、-sodium)、碘苯腈、异乐灵、异丙隆、异恶隆、异恶草胺、Isoxachlortole、异恶氟草、恶草醚、乳氟禾草灵、环草啉、利谷隆、2甲4氯、2甲4氯丙酸、苯噻草胺、Mesotrione、苯嗪草、吡草胺、噻唑隆、色满隆、秀谷隆、异丙甲草胺、唑草磺胺、甲氧隆、赛可津、甲磺隆(-甲酯)、草达灭、绿谷隆、萘丙胺、草萘胺、草不隆、烟嘧磺隆、达草灭、坪草丹、黄草消、炔丙恶唑草、恶草灵、环丙氧磺隆、氟恶嗪草、乙氧氟草醚、百草枯、壬酸、胺硝草、Pendralin、Pentoxazone、甜菜宁、Picolinafen、吡草磷、丙草胺、氟嘧磺隆(-甲酯)、Profluazol、扑草净、毒草胺、敌稗、噁草酸、异丙草胺、Propoxycarbazone(-sodium)、拿草特、苣草丹、氟丙磺隆、氟唑草酯(-乙酯)、Pyrazogyl、吡唑特、吡嘧黄隆(-乙酯)、苣草唑、嘧苯草肟、稗草畏、达草止、Pyridatol、Pyriftalid、肟啉草(-甲酯)、嘧硫苯甲酸(-钠)、二氟喹啉酸、喹草酸、灭藻醌、喹禾灵(精喹禾灵、精喹禾灵四氢糠基酯)、玉嘧磺隆、稀禾啉、西玛津、西草净、磺草酮、磺胺草唑、嘧磺隆(-甲酯)、草甘

腓、乙黄磺隆、丙戊草胺、丁唑隆、Tepaloxym, 特丁津、去草净、噻醚草胺、Thiafluamide、噻氟啶草、噻二唑胺、噻黄隆(-甲酯)、杀草丹、丁草威、肟草酮、野麦畏、醚苯磺隆、苯黄隆(-甲酯)、定草、灭草环、氟乐灵、Trifloxysulfuron、氟胺黄隆(-甲酯)、Tritosulfuron。

对于该混合物, 还可以考虑其它已知的安全剂, 例如

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

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

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

本发明的活性化合物可以在植物发芽前也可以在发芽后使用。也开在播种前掺入土壤中。

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

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

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

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

科(*Streptomycetaceae*)。

举例性, 但非限制性地提及几种落入上述上位概念的真菌或细菌性疾病的病原体:

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

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

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

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

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

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

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

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

霜霉(*Peronospora*), 例如豌豆霜霉(*Peronospora pisi*)或芸苔霜霉(*P. Brassicae*);

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

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

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

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

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

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

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

(分生孢子型: *Drechslera*, 同: 长蠕孢属);

单孢锈菌(*Uromyces*), 例如疣顶单孢锈菌(*Uromyces*

appendiculatus);

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

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

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

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

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

Pyricularia-Arten, 如 *Pyricularia oryzae*;

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

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

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

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

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

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

Pseudocercospora-Arten, 如 *Pseudocercospora herpotrichoides*.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

例如可提及下述属的微生物：

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

香菇属(*Lentinus*)，如 *Lentinus tigrinus*，
青霉属(*Penicillium*)，如灰绿青霉(*Penicillium glaucum*)，
多孔菌属(*Polyporus*)，如变色多孔菌(*Polyporus versicolor*)，
短柄霉属(*Aureobasidium*)，如出芽短柄霉(*Aureobasidium pullulans*)，

Sclerophoma，如 *Sclerophoma pityophila*，

木霉属(*Trichoderma*)，如特德哈氏属(*Trichoderma viride*)，

埃希氏杆菌属 (*Escherichia*), 如大肠杆菌 (*Escherichia coli*),
假单胞菌属 (*Pseudomonas*), 如铜绿色极毛杆菌 (*Pseudomonas aeruginosa*),

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

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

这些制剂是以已知方法制备的, 例如通过将活性化合物与增量剂, 即液体溶剂、在压力下液化的气体和/或固体载体混合而生产, 制剂中任选使用表面活性剂, 即乳化剂和/或分散剂和/或发泡剂。在使用水作为填充剂的情况下, 例如, 也可使用有机溶剂作为助溶剂。适合的液体溶剂主要有: 芳香烃类, 如二甲苯、甲苯或烷基苯; 氯代芳烃类或氯代脂肪烃类, 如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷; 脂肪烃类, 如环己烷或链烷烃, 例如石油馏份; 醇类, 如丁醇或乙二醇及其醚和酯类, 酮类, 如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮; 强极性溶剂, 如二甲基甲酰胺和二甲基亚砷, 以及水。液化的气体增量剂或载体物质是指在常温常压下为气体的液体, 例如气雾推进剂, 如卤代烃类以及丁烷、丙烷、氮和二氧化碳。适合的固体载体有: 例如, 天然矿物粉末, 如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、硅镁土、蒙脱土或硅藻土, 和合成矿物粉末, 如高分散二氧化硅、氧化铝和硅酸盐; 适合颗粒剂的固体载体有: 例如, 粉碎和分级的天然岩石, 如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石, 以及合成的无机和有机粉末颗粒, 以及有机材料的颗粒如锯末、坚果壳、玉米穗茎和烟草茎; 适合的乳化剂和/或发泡剂有: 例如非离子和阴离子乳化剂, 如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚, 例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐以及蛋白水解产物; 适合的分散剂有: 例如木素亚硫酸废液和甲基纤维素。

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

可以使用着色剂如无机颜料,例如氧化铁、二氧化钛和普鲁士兰,和有机染料,如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料,和痕量营养物如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

制剂中通常含有按重量计0.1-95%,优选0.5-90%的活性化合物。

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

作为混合组分例如可考虑如下化合物:

杀真菌剂:

Aldimorph, 氨丙腈酸、氨丙腈酸钾、Andoprim、敌菌灵、戊环唑、腈嘧菌酯,

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

石硫合剂、Capsimycin、敌菌丹、克菌丹、多菌灵、萎锈灵、Carvon、灭螨锰、灭瘟唑、苯咪唑菌、地茂散、氯化苦、百菌清、乙菌利、Clozylacon、硫杂灵、清菌脲、环唑醇、环丙嘧啶、酯菌胺,

双乙氧咪唑威、双氯酚、苄氯三唑醇、Diclofluanid、啞菌清、氯硝胺、乙霉威、噁醚唑、甲菌定、烯酰吗啉、烯唑醇、烯唑醇-M、敌螨普、二苯胺、吡菌硫、灭菌磷、二嗪农、吗菌灵、多果定、敌菌酮,

克瘟散、氧唑菌、乙环唑、乙菌定、氯唑灵,

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

烯菌灵、酰胺唑、双胍辛(Iminoctadin)、双胍辛对十二烷基苯磺酸盐(Iminoctadinealbesilate)、双胍辛醋酸盐、Iodocarb、环戊唑醇、异稻瘟脲(IBP)、异丙定、Irumamycin、富士一号、氯苯咪菌

酮,

春雷霉素、亚胺菌、铜制品, 如, 氢氧化铜、环烷酸铜、氯化铜、硫酸铜、氧化铜、喹啉铜、和碱式硫酸铜混合物,

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

福美镍、异丙消、氟苯嘧啶醇,

甲咪酰胺、噁霜灵、Oxamocarb、噻菌酮、氧化萎锈灵 (Oxycarboxim)、Oxyfenthiin,

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

硫和硫制剂,

戊唑醇、叶枯酞、四氯硝基苯、调环烯、氟醚唑、涕必灵、噻菌腈、溴氯唑菌、甲基托布津、福美双、硫氯苯甲酰胺、甲基立枯磷、对甲抑菌灵、三唑酮、菌唑醇、叶锈特、唑菌嗪、杨菌胺、三环唑、克啉菌、Trifloxystrobin、氟菌唑、噻菌灵、戊叉唑菌,

烯效唑,

有效霉素、烯菌酮、烯霜苄唑,

氟菌胺、代森锌、福美锌以及

咪草酯 G、OK-8705、OK-8801,

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

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

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

α -(5-甲基-1,3-二噁烷-5-基)- β -[[4-(三氟甲基)-苯基]-亚甲基]-1H-1,2,4-三唑-1-乙醇,

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

(E)-a-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-2-苯氧基-苯基乙酰胺,
{2-甲基-1-[[[1-(4-甲基苯基)-乙基]-氨基]-羰基]-丙基}-氨基甲酸-1-异丙基酯,
1-(2,4-二氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-乙酮-0-(苯基甲基)-肟,
1-(2-甲基-1-萘基)-1H-吡咯-2,5-二酮,
1-(3,5-二氯苯基)-3-(2-丙烯基)-2,5-吡咯烷二酮,
1-[(二碘甲基)-磺酰基]-4-甲基-苯,
1-[[2-(2,4-二氯苯基)-1,3-二氧戊环-2-基]-甲基]-1H-咪唑,
1-[[2-(4-氯苯基)-3-苯基环氧乙烷基]-甲基]-1 H-1,2,4-三唑,
1-[1-[2-[(2,4-二氯苯基)-甲氧基]-苯基]-乙烯基]-1H-咪唑,
1-甲基-5-壬基-2-(苯基甲基)-3-吡咯烷醇 (pyrrolidinol),
2',6'-二溴-2-甲基-4'-三氟甲氧基-4'-三氟甲基-1,3-噻唑-5-甲酰苯胺 (carboxanilid),
2,2-二氯-N-[1-(4-氯苯基)-乙基]-1-乙基-3-甲基环丙烷甲酰胺,
2,6-二氯-5-(甲基硫基)-4-嘧啶基硫氰酸酯,
2,6-二氯-N-(4-三氟甲基苄基)-苯甲酰胺,
2,6-二氯-N-[[4-(三氟甲基)-苯基]-甲基]-苯甲酰胺,
2-(2,3,3-三碘-2-丙烯基)-2H-四唑,
2-[(1-甲基乙基)-磺酰基]-5-(三氟甲基)-1,3,4-噻二唑,
2-[[6-去氧-4-O-(4-O-甲基-β-3-D-吡喃葡萄糖苷基)-α-D-吡喃葡萄糖基]-氨基]-4-甲氧基-1H-吡咯并[2,3-d]嘧啶-5-腈,
2-氨基丁烷,
2-溴-2-(溴甲基)-戊烷二腈,
2-氯-N-(2,3-二氢-1,1,3-三甲基-1H-茛-4-基)-3-吡啶甲酰胺
2-氯-N-(2,6-二甲基苯基)-N-(异硫氰酸根合甲基)-乙酰胺,
2-苯基苯酚 (OPP),
3,4-二氯-1-[4-(二氟甲氧基)-苯基]-1H-吡咯-2,5-二酮,
3,5-二氯-N-[氟基[(1-甲基-2-丙炔基)-氧基]-甲基]-苯甲酰胺,

3-(1,1-二甲基丙基-1-氧代-1H-茛-2-脲,
3-[2-(4-氯苯基)-5-乙氧基-3-异噁唑烷基]-吡啶,
4-氯-2-氟基-N,N-二甲基-5-(4-甲基苯基)-1H-咪唑-1-磺酰胺,

4-甲基-四唑并[1,5-a]喹唑啉-5(4H)-酮,
8-(1,1-二甲基乙基)-N-乙基-N-丙基-1,4-二氧杂螺[4.5]癸烷-2-甲胺,

8-羟基喹啉硫酸盐,
9H-咕吨-9-甲酸-2-[(苯基氨基)-羰基]-酰肼,
双-(1-甲基乙基)-3-甲基-4-[(3-甲基苯甲酰基)-氧基]-2,5-噻吩二甲酸酯,

顺-1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-环庚醇,
顺-4-[3-[4-(1,1-二甲基丙基)-苯基-2-甲基丙基]-2,6-二甲基-吗啉盐酸盐,

[(4-氯苯基)-偶氮]-氟基乙酸乙酯,

碳酸氢钾,

甲烷四硫醇钠盐,

1-(2,3-二氢-2,2-二甲基-1H-茛-1-基)-1H-咪唑-5-甲酸甲酯,
N-(2,6-二甲基苯基)-N-(5-异噁唑基羰基)-DL-丙氨酸甲酯,
N-(氯乙酰基)-N-(2,6-二甲基苯基)-DL-丙氨酸甲酯,
N-(2,3-二氯-4-羟基苯基)-1-甲基-环己烷甲酰胺,
N-(2,6-二甲基苯基)-2-甲氧基-N-(四氢-2-氧代-3-咪唑基)-乙酰胺,

N-(2,6-二甲基苯基)-2-甲氧基-N-(四氢-2-氧代-3-噻吩基)-乙酰胺,

N-(2-氯-4-硝基苯基)-4-甲基-3-硝基-苯磺酰胺,
N-(4-环己基苯基)-1,4,5,6-四氢-2-嘧啶胺,
N-(4-己基苯基)-1,4,5,6-四氢-2-嘧啶胺,
N-(5-氯-2-甲基苯基)-2-甲氧基-N-(2-氧代-3-噁唑烷基)-乙酰胺,

N-(6-甲氧基)-3-吡啶基)-环丙烷甲酰胺,

N-[2,2,2-三氯-1-[(氯乙酰基)-氨基]-乙基]-苯甲酰胺,

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

N-甲酰基-N-羟基-DL-丙氨酸-钠盐,

0,0-二乙基-[2-(二丙基氨基)-2-氧代乙基]-乙基硫代氨基磷酸
酯(ethylphosphoramidothioat)

0-甲基-S-苯基-苯基丙基硫代氨基磷酸酯,

1,2,3-苯并噻二唑-7-硫代羧酸 S-甲酯,

螺[2H]-1-苯并吡喃-2,1'(3'H)-异苯并呋喃]-3'-酮,

4-[(3,4-二甲氧基苯基)-3-(4-氟苯基)-丙烯酰基]-吗啉

杀菌剂:

溴硝丙二醇、双氯酚、氯定、福美镍、春雷霉素、异噻菌酮、呋喃甲酸、土霉素、噻菌灵、链霉素、叶枯酞、硫酸铜和其它铜制剂。

杀虫剂/杀螨剂/杀线虫剂:

阿维菌素、乙酰甲胺磷、啉虫脒、氟丙菊酯、棉铃威、涕灭威、涕灭砒威、甲体氯氟菊酯(Alphacypermethrin)、甲体氯氟菊酯(Alphamethrin)、双甲脒、齐墩螨素、AZ 60541、艾扎丁、甲基吡啶磷、谷硫磷 A、谷硫磷 M、三唑锡,

波林杆菌芽孢、Bacillus sphaericus、柯敌克菌、苏金杆菌、Baculoviruses、Beauveria bassiana、Beauveria tenella、噁虫威、丙硫克百威、杀虫磺、苯螨特、β-氟氯氟菊酯、联苯腈酯、联苯菊酯、Bioethanomethrin、生物氯菊酯、Bistrifluron、BPMC、溴硫磷 A、合杀威、噻嗪酮、特密硫磷、丁酮威、丁基吡啶灵(Butylpyridaben)、

硫线磷、甲萘威、克百威、三硫磷、丁硫克百威、杀螟丹、Chloethocarb、氯氧磷、氯唑虫清、毒虫畏、氟啶脲、氯甲硫磷、毒死蜱、毒死蜱 M、Chlovaporthrin、Chromafenozide、顺式灭虫菊(Cis-Resmethrin)、Cispermethrin、Clocythrin、除线威、四螨嗪、Clothianidine、杀螟腈、Cycloprene、乙氧菊酯、氟氯氟菊酯、氯氯氟菊酯、三环锡、氯氟菊酯、灭蝇胺,

溴氟菊酯、内吸磷 M、内吸磷 S、甲基内吸磷、丁醚脲、二嗪磷、敌敌畏、氟脲杀、开乐散、乐果、甲基毒虫畏、苯虫醚、乙拌磷、磷酰丁二辛、苯氧炔螨、

Eflusilanate、Emamectin、右旋烯炔菊酯、硫丹、Entomopftthora spp.、高氟戊菊酯、苯虫威、乙硫磷、灭克磷、醚菊酯、特苯噁唑、氧嘧啶磷，

克线磷、喹螨醚、杀螨锡、杀螟硫磷、苯硫威、Fenoxacrim、双氧威、甲氧菊酯、Fenpyrad、Fenpyrithrin、唑螨酯、杀灭菊酯、锐劲特、氟啶胺、氟啶蜱脲、Flubrocyclothrinate、氟蜱脲、氟氟戊菊酯、氟虫脲、氟氟苯菊酯、Flutenzine、氟胺氟菊酯、地虫磷、丁苯硫磷、噻唑酮磷、Fubfenprox、吡线威，

颗粒层增殖病毒，

特丁苯酞肼、HCH、庚虫磷、氟铃脲、噻螨酮、烯虫乙酯，

吡虫啉、噁二唑虫、氯唑磷、丙胺磷、异噁唑磷、齐墩螨素，

核多角体病毒，

氟氟菊酯、氟丙氧脲，

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

二溴磷、硝胺烯啶、硝虫噻嗪、双苯氟脲，

氧乐果、甲胺叉威、砒吸磷，

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

喹噁磷，

Ribavirin，

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

氟胺氟菊酯、双苯酞肼、吡螨胺、噻丙磷(Tebupirimiphos)、氟虫隆、七氟菊酯、双硫磷、灭虫威、特丁磷、杀虫威、三氯杀螨砒、辛体氟氟菊酯、噻虫啉(Thiacloprid)、Thiamethoxam、蛾蝇脲、Thiatriphos、硫环杀、硫双威、久效威、敌贝特、溴氟氟菊酯、四溴

菊酯、苯螨塞、唑蚜威、三唑磷、Triazuron、Trichlophenidine、
敌百虫、杀虫隆、混杀威，

蚜灭多、氟吡唑虫、麦柯特尔，

YI 5302，

Zeta-cypermethrin、Zolaprofos，

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

2,2,3,3-四甲基环丙烷甲酸[(3-苯氧基苯基)-甲基]酯，

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

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

2-(乙酰基氧基)-3-十二烷基-1,4-萘二酮，

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

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

丙基氨基甲酸(3-甲基苯基)酯，

4-[4-(4-乙氧基苯基)-4-甲基戊基]-1-氟-2-苯氧基-苯，

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

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

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

苏云金杆菌菌株 EG-2348，

苯甲酸[2-苯甲酰基-1-(1,1-二甲基乙基)-酰肼，

丁酸[2,2-二甲基-3-(2,4-二氯苯基)-2-氧代-1-氧杂螺[4.5]癸
-3-烯-4-基]酯，

[3-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-噻唑烷亚基]-氨基氟，

二氢-2-(硝基亚甲基)-2H-1,3-噻嗪-3(4H)-甲醛，

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

N-(3,4,4-三氟-1-氧代-3-丁烯基)-甘氨酸,

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

N-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-N'-甲基-N''-硝基-胍,

N-甲基-N'-(1-甲基-2-丙烯基)-1,2-胂二硫代甲酰胺,

N-甲基-N'-2-丙烯基-1,2-胂二硫代甲酰胺,

0,0-二乙基-[2-(二丙基氨基)-2-氧代乙基]-乙基硫代氨基磷酸酯,

N-氟基甲基-4-三氟甲基-烟酰胺

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

与其它已知活性化合物例如除草剂或与肥料以及生长调节剂的混合物也是可能的。

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

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

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

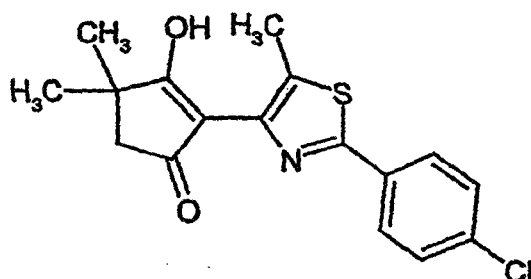
化合物的用量一般为每千克种子 0.001 至 50 g, 优选为每千克种子 0.01 至 10 g。在处理土壤时, 活性化合物的用量一般为 0.1-10,000 g/ha, 优选为 1-5,000 g/ha。

具体实施方式

通过下述实施例说明本发明活性化合物的制备和应用。

制备实施例

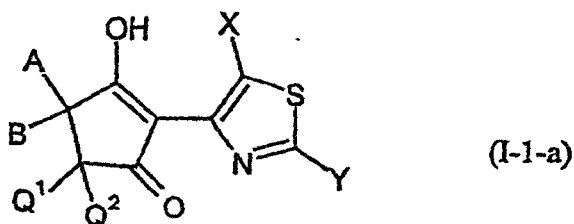
实施例 I-1-a-1



将 1.65 g (14.4 毫摩尔)叔丁醇钾加到 30 ml 无水二甲基甲酰胺 (DMF) 中并滴加 3.5 g (9.6 毫摩尔) 实施例 (II-1) 的化合物在 10 ml 无水 DMF 中的溶液, 在 50℃ 搅拌 3 小时, 然后将该反应混合物倒入 100 ml 冰水中, 将该混合物加到 600 ml 冷的 1N HCl-溶液中, 抽滤沉淀并干燥。

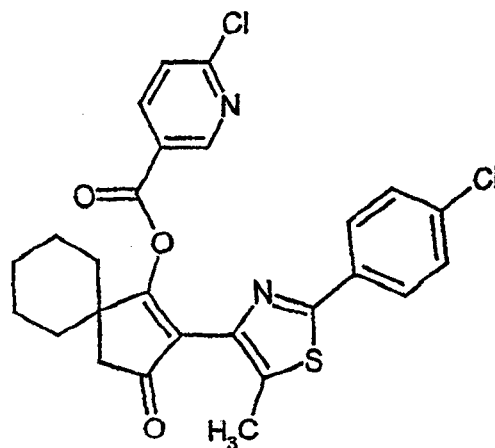
收率: 2.9 g (理论量的 90%), 熔点: 139-141℃

类似于实施例 (I-1-a-1) 并按照所述制备的一般说明制得下述式 (I-1-a) 化合物:



实施例 编号	X	Y	B	A	Q ¹	Q ²	熔点 °C
I-1-a-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	105-107°C
I-1-a-3	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	121-123°C
I-1-a-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		H	H	130
I-1-a-5	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	油状物
I-1-a-6	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₄ -		H	145-148
I-1-a-7	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	85
I-1-a-8	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -O-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	75-77
I-1-a-9	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	H	142-144
I-1-a-10	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	H	127
I-1-a-11	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	C ₆ H ₅ -	H	H	130
I-1-a-12	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		H	H	210
I-1-a-13	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	C ₆ H ₁₁ -	H	H	105
I-1-a-14	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CH-C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -		H	H	油状物
I-1-a-15	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CH-t-C ₄ H ₉ -(CH ₂) ₂ -		H	H	油状物
I-1-a-16	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CH-C ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		H	H	油状物
I-1-a-17	H	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	185

实施例 I-1-b-1



将 500mg (1.33 mmol) 实施例 I-1-a-2 化合物加到 5 ml 无水二氯甲烷中并加入 0.27 ml (2.0 mmol) 三乙胺。在 0°C 下加入 0.30 g (1.74 mmol) 6-氯烟酰氯并在室温下搅拌混合物 2 小时, 然后再加入 0.15 g 氯烟酰氯和 0.13 ml 三乙胺。

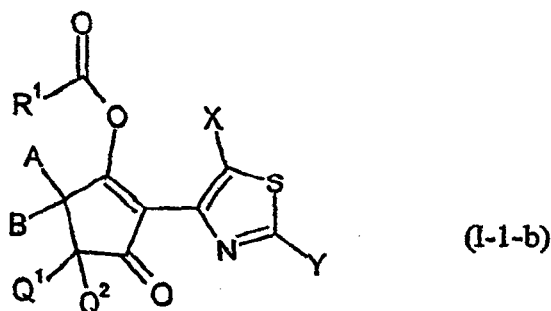
用 10% 的柠檬酸溶液洗涤该反应混合物, 水相用二氯甲烷萃取,

然后有机相用 1 N 的氢氧化钠溶液洗涤并用二氯甲烷萃取水相。

干燥有机相并蒸出溶剂，将残余物与石油醚一起搅拌并过滤和干燥。

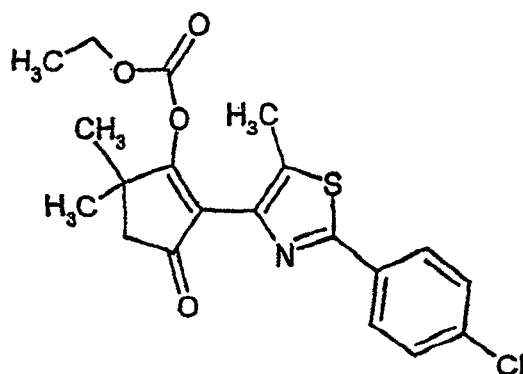
收率：0.7 g (理论量的 100%)，熔点：133-134℃。

类似于实施例 (I-1-b-1) 并按照所述制备的一般说明制得下述式 (I-1-b) 化合物：



实施例 编号	X	Y	B	A	Q ¹	Q ²	R ¹	熔点 °C
I-1-b-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	H ₅ C ₂ -O-CH ₂ -	135
I-1-b-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	i-C ₃ H ₇	油状物
I-1-b-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	129-130
I-1-b-5	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H		油状物

实施例 I-1-c-1



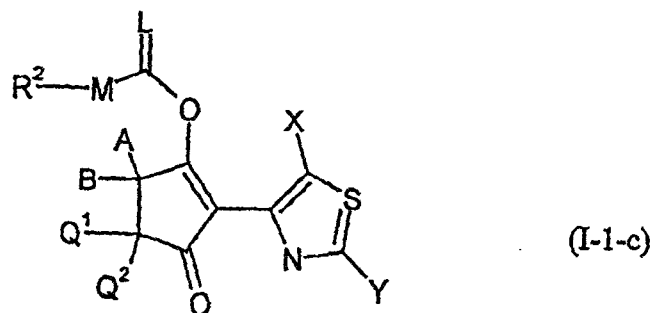
将 500 mg (1.5 毫摩尔) 实施例 (I-1-a-1) 的化合物加到 5 ml 无水二氯甲烷中并加入 0.3 ml (2.25 毫摩尔) 三乙胺，在 0℃ 下加入 0.225 g (1.95 毫摩尔) 氯甲酸乙酯并在室温下搅拌 2 小时。

用 10% 的柠檬酸洗涤反应液，水相用二氯甲烷 (CH₂Cl₂) 萃取，有机

相用 1 N 氢氧化钠溶液洗涤，干燥并浓缩。

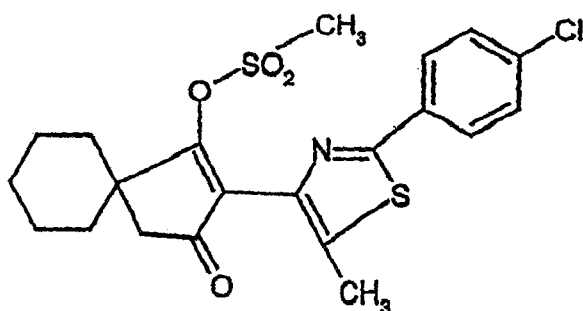
收率：0.45 g (理论量的 75%)，132-134℃

类似于实施例 (I-1-c-1) 和按照所述制备的一般说明得到下述式 (I-1-c) 化合物：



实施例 编号	X	Y	A	B	Q ¹	Q ²	L	M	R ²	熔点 °C
I-1-c-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	O	O	C ₂ H ₅	油状物
I-1-c-3	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	O	O	C ₂ H ₅	油状物
I-1-c-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	O	O	C ₆ H ₅	139-140
I-1-c-5	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	O	S	C ₆ H ₅ -CH ₂	144
I-1-c-6	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	O	O	C ₆ H ₅ -CH ₂	137

实施例 I-1-d-1



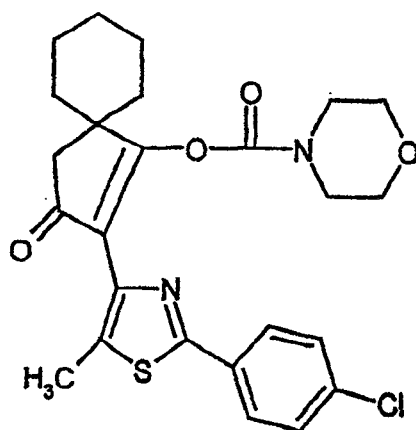
将 0.5 g (1.33 毫摩尔) 实施例 I-1-a-2 的化合物加到 5 ml 无水二氯甲烷中并加入 0.27 ml (2.0 毫摩尔) 三乙胺，在冰冷却下加入 0.135 ml (1.74 毫摩尔) 甲磺酰氯并在室温下搅拌 2 小时。

用 10% 的柠檬酸萃取反应混合物，水相用二氯甲烷洗涤，有机相用 1 N 氢氧化钠溶液萃取并用二氯甲烷洗涤水相，干燥并浓缩。

收率：0.6 g (理论量的 100%)，熔点 134℃

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$, 400 MHz): $\delta = 1.02 - 1.75$ (m, 10H, 环己基 $-\text{CH}_2$), 2.30 (s, 3H, 噻唑基 $-\text{CH}_3$), 3.05 (s, 2H, $\text{CH}_2\text{-CO}$), 3.61 (s, 3H, $\text{SO}_2\text{-CH}_3$), 7.54 (d, 2H, Ar-H), 7.86 (d, 2H, Ar-H) ppm.

实施例 I-1-g-1



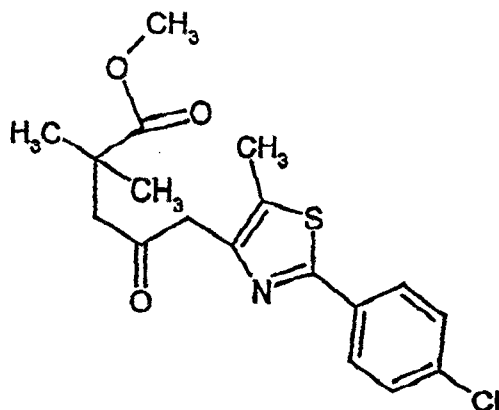
将 0.5 g (1.33 毫摩尔) 实施例 I-1-a-2 的化合物和 0.27 ml (2.0 毫摩尔) 三乙胺溶于 5 ml 无水二氯甲烷中, 在冰冷却下加入 0.26 g (1.73 毫摩尔) 吗啉-N-甲酰氯并在室温下搅拌过夜。

用 10% 的柠檬酸萃取反应混合物, 水相用二氯甲烷洗涤, 有机相用 1 N 氢氧化钠溶液萃取并用二氯甲烷洗涤水相, 干燥并浓缩。

收率: 0.69 g (理论量的 93%), 蜡状

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$, 400 MHz): $\delta = 1.02 - 1.74$ (m, 10H, 环己基 $-\text{CH}_2$), 2.30 (s, 3H, 噻唑基 $-\text{CH}_3$), 3.01 (s, 2H, $\text{CH}_2\text{-CO}$), 3.05 - 3.79 (m, 8H, 吗啉 $-\text{CH}_2$), 7.54 (d, 2H, Ar-H), 7.85 (d, 2H, Ar-H) ppm.

实施例 II-1



将 17.3 g (30 毫摩尔) 实施例 XIV-1 的化合物加到 200 ml 无水丙酮中并加入 6.8 g (49 毫摩尔) 碳酸钾和 20.5 g (147 毫摩尔) 碘甲烷, 回流搅拌 16 小时。

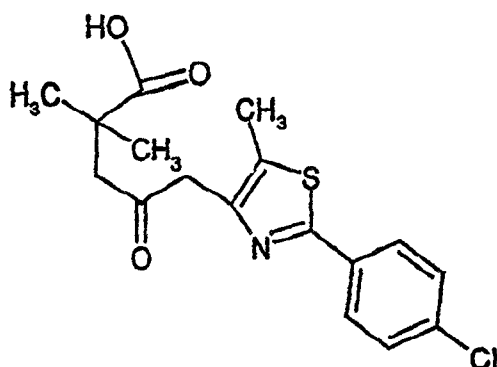
过滤该溶液, 蒸出溶剂, 经硅胶柱色谱进行纯化(二氯甲烷 : 石油醚, 4 : 1 → 二氯甲烷 → 二氯甲烷 : 乙酸乙酯, 30 : 1 → 10 : 1)。

收率: 3.5 g (理论量的 31%), 油状物

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO, 400 MHz):

δ = 1.11 (s, 6H, 2- CH_3 -C-脂肪族), 2.31 (s, 3H, CH_3 -C-杂芳族), 3.50 (s, 3H, CH_3 -O), 7.50 (d, 2H, 2-CH-芳族), 7.84 (d, 2H, 2-CH-芳族) ppm.

实施例 XIV-1



在 -15°C 下, 向 25 ml LDA*-溶液 (2 M) 在 50 ml 无水四氢呋喃 (THF) 中的溶液中滴加 12.7 g (45 毫摩尔) 4-[2-(4-氯苯基)-5-甲基]-噻唑基-乙酸甲酯在 15 ml THF 中的溶液并在 0°C 下搅拌 60 分钟。

然后, 在 -15°C 下滴加 3.8 g (30 毫摩尔) 2,2-二甲基琥珀酸酐在 10 ml 无水 THF 中的溶液。

在室温下搅拌该溶液 2 小时, 然后加入 75 ml 水和 20 g 氯化铵并用浓盐酸酸化该溶液。

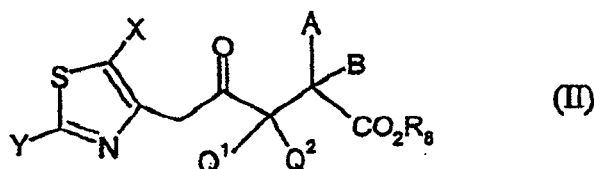
用乙醚萃取该中间体并蒸发溶剂, 将残余物与 25 g KOH 和 170 ml 水加热回流 1 天。

将混合物冷却, 用浓 HCl 酸化并用乙醚萃取, 该粗产品不进行进一步表征和纯化直接转化成化合物 II-1。

收率: 17.5 g (理论量的 100%), 油状物

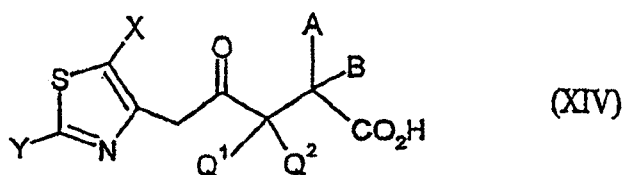
*LDA = 二异丙基氨基化锂

类似于实施例 (II-1) 和按照所述制备的一般说明得到下述式 (II) 化合物:



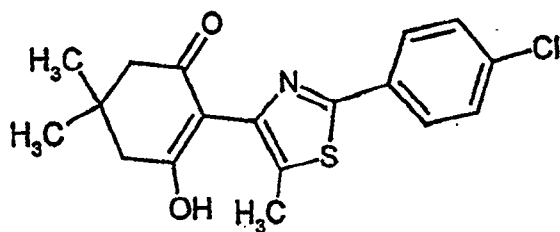
实施例 编号	X	Y	B	A	Q ¹	Q ²	R ⁸	熔点 °C
II-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	CH ₃	油状物
II-3	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	CH ₃	油状物
II-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH ₃	油状物
II-5	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	CH ₃	油状物
II-6	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₄ -		H	CH ₃	油状物
II-7	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	CH ₃	油状物
II-8	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -O-C ₆ H ₄ -	-(CH ₂) ₅ -		H	H	CH ₃	油状物
II-9	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	H	CH ₃	油状物
II-10	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	H	CH ₃	油状物
II-11	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	C ₆ H ₅ -		H	CH ₃	油状物
II-12	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH ₃	油状物
II-13	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	C ₆ H ₁₁		H	CH ₃	油状物
II-14	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CH-C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -		H	H	CH ₃	油状物
II-15	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CH-C ₄ H ₉ -(CH ₂) ₂ -		H	H	CH ₃	油状物
II-16	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CH-C ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		H	H	CH ₃	油状物
II-17	H	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	CH ₃	油状物

类似于实施例 (XIV-1) 和按照所述制备的一般说明得到下述式 (XIV) 化合物:



实施例 编号	X	Y	B	A	Q ¹	Q ²	熔点 °C
XIV-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	蜡状物
XIV-3	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	蜡状物
XIV-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		H	H	油状物
XIV-5	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	油状物
XIV-6	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₄ -		H	油状物
XIV-7	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	油状物
XIV-8	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -O-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	油状物
XIV-9	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	H	油状物
XIV-10	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	H	油状物
XIV-11	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	C ₆ H ₅ -	H	H	油状物
XIV-12	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		H	H	油状物
XIV-13	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	C ₆ H ₁₁ -	H	H	油状物
XIV-14	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CH-C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -		H	H	油状物
XIV-15	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CH-t-C ₄ H ₉ -(CH ₂) ₂ -		H	H	油状物
XIV-16	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CH-C ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		H	H	油状物
XIV-17	H	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	油状物

实施例 I-2-a-1



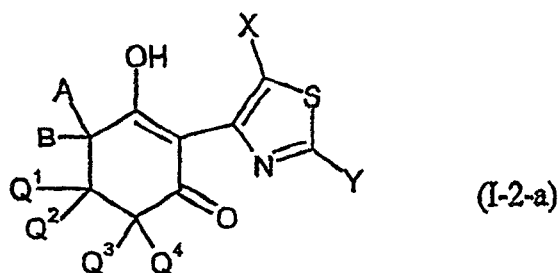
将 2.16 g (18.1 毫摩尔) 叔丁醇钾加到 20 ml 无水 DMF 中并滴加 4.6 g (12.1 毫摩尔) 实施例 III-1 化合物在 2 ml 无水 DMF 中的

溶液。在 50℃ 下搅拌混合物 2 小时。

将该反应溶液倒入 100 ml 冰水中并在搅拌下将该混合物加到 500 ml 冷的 1 N HCl-溶液中，抽滤沉淀并用二氯甲烷处理。蒸出溶剂后，通过硅胶柱色谱纯化残余物(环己烷/乙酸乙酯，5 : 1)。

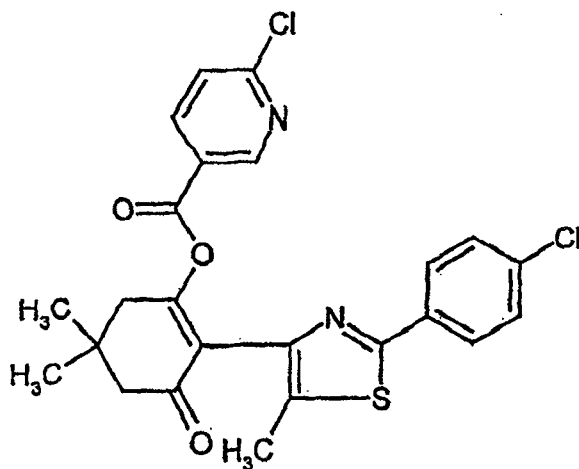
收率：1.4 g (理论量的 13%)，熔点：165-167℃

类似于实施例 (I-2-a-1) 和按照所述制备的一般说明得到下述式 (I-2-a) 化合物：



实施例 编号	X	Y	A	B	Q ¹	Q ²	Q ³	Q ⁴	熔点 °C
I-2-a-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	H	H	H	H	106
I-2-a-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	油状物
I-2-a-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	H	122
I-2-a-5	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	H	195-197

实施例 I-2-b-1



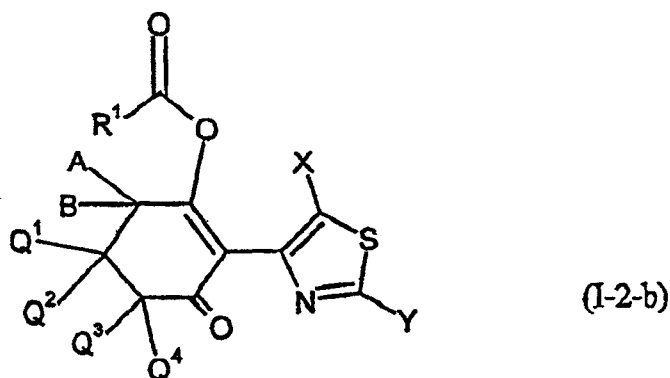
将 500 mg (1.44 毫摩尔) 实施例 I-2-a-1 化合物加到 5 ml 无水 CH₂Cl₂ 中并加入 0.29 ml (2.16 毫摩尔) 三乙胺，在 0℃ 下加入 0.33 g

(1.87 毫摩尔) 6-氯烟酰氯并在室温下搅拌该混合物 2 小时。

用 10% 的柠檬酸萃取该溶液，水相用 CH_2Cl_2 洗涤，有机相用 1 N NaOH 萃取并且水相用二氯甲烷洗涤，干燥和浓缩。

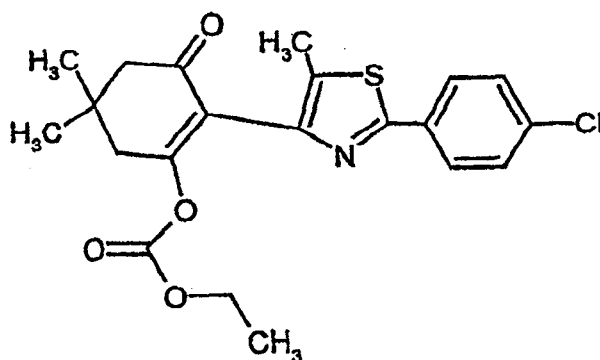
收率：0.7 g (理论量的 100%)，熔点：127-130°C

类似于实施例 (I-2-b-1) 和按照所述制备的一般说明得到下述式 (I-2-b) 化合物：



实施例 编号	X	Y	A	B	Q¹	Q²	Q³	Q⁴	R¹	熔点 °C
I-2-b-2	CH₃	4-Cl-C₆H₄	H	H	CH₃	CH₃	H	H	i-C₃H₇-	96
I-2-b-3	CH₃	4-Cl-C₆H₄	H	H	CH₃	CH₃	H	H	H₃C₂-O-CH₂-	142
I-2-b-4	CH₃	4-Cl-C₆H₄	H	H	CH₃	CH₃	H	H	4-Cl-C₆H₄	123-125
I-2-b-5	CH₃	4-Cl-C₆H₄	H	H	CH₃	CH₃	H	H		128

实施例 I-2-c-1



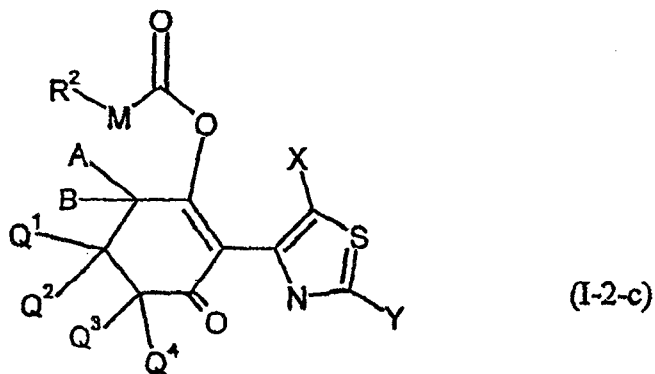
将 600 mg (1.7 毫摩尔) 实施例 I-2-a-1 化合物加到 5 ml 无水 CH_2Cl_2 中并加入 0.35 ml (2.60 毫摩尔) 三乙胺，在 0°C 下加入 0.255

g (2.21 毫摩尔) 氯甲酸乙酯并在室温下搅拌 2 小时。

用 10% 的柠檬酸洗涤该溶液, 水相用 CH_2Cl_2 萃取, 有机相用 1 N NaOH 洗涤, 干燥和浓缩。

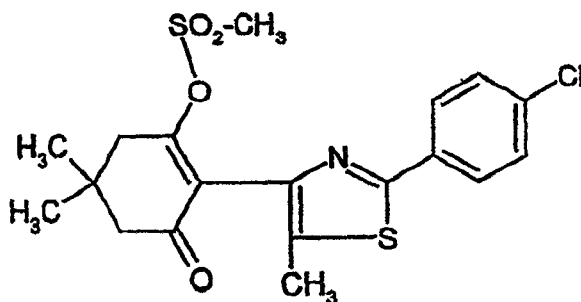
收率: 0.62 g (理论量的 87%), 熔点: 82-86 $^{\circ}\text{C}$

类似于实施例 (I-2-c-1) 和按照所述制备的一般说明得到下述式 (I-2-c) 化合物:



实施例 编号	X	Y	A	B	Q ¹	Q ²	Q ³	Q ⁴	M	R ²	熔点 $^{\circ}\text{C}$
I-2-c-2	CH_3	4-Cl- C_6H_4	H	H	CH_3	CH_3	H	H	O	C_6H_5	123-125
I-2-c-3	CH_3	4-Cl- C_6H_4	H	H	CH_3	CH_3	H	H	O	$\text{C}_6\text{H}_5\text{-CH}_2$	129-131
I-2-c-4	CH_3	4-Cl- C_6H_4	H	H	CH_3	CH_3	H	H	S	$\text{C}_6\text{H}_5\text{-CH}_2$	94

实施例 I-2-d-1



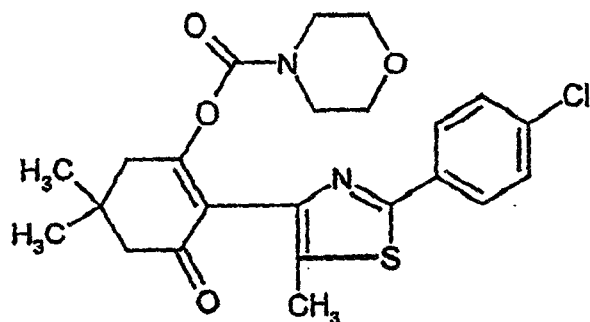
将 500 mg (1.44 毫摩尔) 实施例 I-2-a-1 化合物加到 5 ml 无水 CH_2Cl_2 中并加入 0.29 ml (2.16 毫摩尔) 三乙胺, 在 0 $^{\circ}\text{C}$ 下加入 0.22 g (1.87 毫摩尔) 甲磺酰氯并在室温下搅拌 2 小时。

用 10% 的柠檬酸萃取该反应混合物, 水相用 CH_2Cl_2 洗涤, 有机相用 1 N NaOH 萃取并且水相用 CH_2Cl_2 洗涤, 干燥和浓缩。

收率: 0.65 g (理论量的 100%), 蜡状

$\delta = 1.17$ (s, 6H, 环己基 $-\text{CH}_3$), 2.25 (s, 3H, 噻唑基 $-\text{CH}_3$), 2.48 (s, 2H, 环己基 $-\text{CH}_2$), 2.86 (s, 2H, 环己基 $-\text{CH}_2$), 3.21 (s, 3H, SO_2-CH_3), 7.52 (d, 2H, Ar-H), 7.83 (d, 2H, Ar-H) ppm.

实施例 I-2-g-1



将 500 mg (1.44 毫摩尔) 实施例 I-2-a-1 化合物加到 5 ml 无水 CH_2Cl_2 中并加入 0.29 ml (2.16 毫摩尔) 三乙胺, 在 0°C 下加入 0.22 g (1.87 毫摩尔) 吗啉甲酰氯并在室温下搅拌 2 小时。

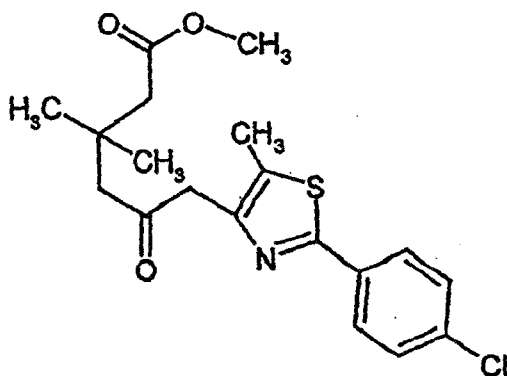
用 10% 的柠檬酸萃取该反应混合物, 水相用 CH_2Cl_2 洗涤, 有机相用 1 N NaOH 萃取并且水相用 CH_2Cl_2 洗涤, 干燥和浓缩。

收率: 0.65 g (理论量的 100%), 熔点 128°C

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$, 400 MHz):

$\delta = 1.13$ (s, 6H, 环己基 $-\text{CH}_3$), 2.21 (s, 3H, 噻唑基 $-\text{CH}_3$), 2.46 (s, 2H, 环己基 $-\text{CH}_2$), 2.71 (s, 2H, 环己基 $-\text{CH}_2$), 3.06-3.80 (m, 8H, 吗啉 $-\text{CH}_2$), 7.53 (d, 2H, Ar-H), 7.84 (d, 2H, Ar-H) ppm.

实施例 III-1



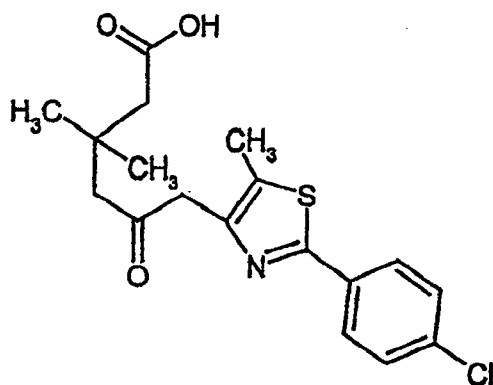
将 17.0 g (30 毫摩尔) 实施例 XIX-1 化合物的粗品加到 200 ml 无水丙酮中并加入 6.42 g (46.5 毫摩尔) 碳酸钾和 19.5 g (139.5 毫摩尔) 碘甲烷, 在回流下搅拌 16 小时。过滤该混合物并浓缩, 残余物经硅胶柱色谱纯化 (二氯甲烷 : 石油醚, 4 : 1 → 二氯甲烷 → 二氯甲烷 : 乙酸乙酯, 30 : 1 → 10 : 1)

收率: 4.6 g (理论量的 16%), 油状物

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 1.03$ (s, 6H, 2- $\text{CH}_3\text{-C}$ -脂肪族), 2.32 (s, 3H, $\text{CH}_3\text{-C}$ -芳族), 7.50 (d, 2H, 2-CH-芳族), 7.81 (d, 2H, 2-CH-芳族) ppm.

实施例 XIX-1



在 -15°C 下, 向 25 ml LDA-溶液 (2 M) 在 50 ml 无水四氢呋喃中的溶液中滴加 12.7 g (45 毫摩尔) 4-[2-(4-氯苯基)-5-甲基]-噻唑基-乙酸甲酯在 15 ml 无水 THF 中的溶液并在 0°C 下搅拌混合物 60 分钟。

然后在 -15°C 下向其中滴加 4.26 g (30 毫摩尔) 3,3-二甲基戊二酸酐在 10 ml THF 中的溶液。

在室温下搅拌该溶液 2 小时, 然后加入 75 ml 水和 20 g 氯化铵并随后用浓盐酸酸化。

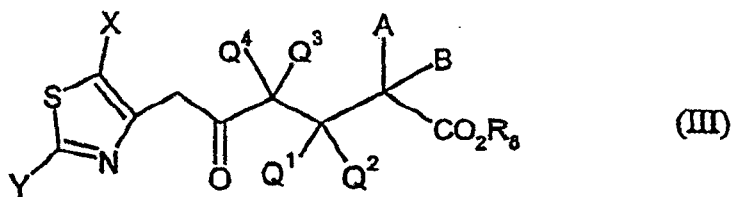
用乙醚萃取该中间体并蒸发溶剂, 将残余物与 25 g KOH 和 170 ml 水加热回流 1 天。

将混合物冷却, 用浓 HCl 酸化并用乙醚萃取, 该粗产品不进行纯化直接进一步反应。

收率: 17 g (理论量的 100%), 油状物

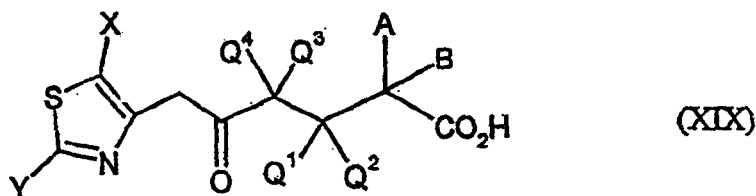
类似于实施例 (III-1) 和按照所述制备的一般说明得到下述式

(III) 化合物:



实施例 编号	X	Y	A	B	Q ¹	Q ²	Q ³	Q ⁴	R ⁸	熔点 °C
III-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	H	H	H	H	CH ₃	油状物
III-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	油状物
III-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	H	CH ₃	油状物
III-5	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	H	CH ₃	油状物

类似于实施例 (XIX-1) 和按照所述制备的一般说明得到下述式 (XIX) 化合物:



实施例 编号	X	Y	A	B	Q ¹	Q ²	Q ³	Q ⁴	熔点 °C
XIX-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	H	H	H	H	油状物
XIX-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	油状物
XIX-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	H	油状物
XIX-5	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	H	油状物

应用实施例

实施例 A

Meloidogyne-试验

溶剂: 30 重量份二甲基甲酰胺

乳化剂: 1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

为制备合适的活性化合物制剂, 将 1 重量份活性化合物与上述量的溶剂和乳化剂混合, 并用水稀释浓缩物至所需浓度。

将砂子、活性化合物溶液、Meloidogyne incognita-卵-幼虫的

混悬液和莴苣种子装填于容器中。莴苣种子发芽并发育成幼苗。在根部形成瘿。

在规定时间内根据瘿的形成确定用%表示的杀线虫活性。其中100%表示没有发现瘿的形成；0%表示处理过的植物的瘿的数量与未处理的对照相当。

在该试验中，例如下述制备实施例的化合物显示出良好活性：

活性化合物	活性化合物的浓度, ppm	14 天后的杀死率, %
实施例 I-1-c-3	20	100
实施例 I-1-a-1	20	95

实施例 B

瘤蚜 (Myzus)-试验 (系统作用)

溶剂： 7 重量份二甲基甲酰胺

乳化剂： 2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

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

各用 10ml 所需浓度的活性化合物制剂浇灌被桃蚜虫 (桃瘤蚜) 严重侵袭的皱叶甘蓝 (*Brassica oleracea*)，使活性化合物制剂渗入土壤中，而不润湿嫩芽。活性化合物被根部吸收并转移至嫩芽。

在规定时间内测定用%表示的杀死率。其中100%表示所述蚜虫都被杀死；0%表示没有蚜虫被杀死。

在该试验中，例如下述制备实施例的化合物显示出良好活性：

活性化合物	活性化合物的浓度, ppm	10 天后的杀死率, %
实施例 I-1-c-2	20	95

实施例 C

Phaedon-幼虫试验

溶剂： 7 重量份二甲基甲酰胺

乳化剂： 2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

为制备适合的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与上述量

的溶剂和乳化剂混合，并用含有乳化剂的水稀释浓缩物至所需浓度。

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

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

在该试验中，例如下述制备实施例的化合物显示出良好活性：

活性化合物	活性化合物的浓度, ppm	7 天后的杀死率, %
实施例 I-1-c-1	500	100
实施例 I-2-c-1	500	100

实施例 D

草地贪夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*)-试验

溶剂： 7 重量份二甲基甲酰胺

乳化剂： 2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

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

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

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

在该试验中，例如下述制备实施例的化合物显示出良好活性：

活性化合物	活性化合物的浓度, ppm	7 天后的杀死率, %
实施例 I-1-a-2	500	100
实施例 I-2-a-1	500	100
实施例 I-1-c-1	500	100
实施例 I-2-c-1	500	100

实施例 E

红叶螨 (*Tetranychus*)-试验 (OP-抗性/浸入处理)

溶剂： 30 重量份二甲基甲酰胺

乳化剂：1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

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

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

在规定时间内测定用 % 表示的效果。其中 100 % 表示所述螨都被杀死；0 % 表示没有螨被杀死。

在该试验中，例如下述制备实施例的化合物显示出良好活性：

活性化合物	活性化合物的浓度, ppm	7 天后的杀死率, %
实施例 I-1-c-3	100	98
实施例 I-1-a-1	100	100
实施例 I-2-a-2	100	99
实施例 I-2-a-1	100	98
实施例 I-1-c-1	100	95
实施例 I-2-c-1	100	100

实施例 F1

芽后-试验

溶剂：5 重量份丙酮

乳化剂：1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

为制备适合的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与上述量的溶剂混合，加入上述量的乳化剂，并用水稀释浓缩物至所需浓度。

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

3 周后记录植物受损害的程度，用相对于未处理的对照发育的 % 表示。

对此，0% = 无作用（如未处理的对照）

100% = 完全毁掉

实施例 F₂

芽前-试验

溶剂: 5 重量份丙酮

乳化剂: 1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

为制备适合的活性化合物制剂, 将 1 重量份活性化合物与上述量的溶剂混合, 加入上述量的乳化剂, 并用水稀释浓缩物至所需浓度。

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

3 周后记录植物受损害的程度, 用相对于未处理的对照发育的 % 表示。

对此, 0% = 无作用 (如未处理的对照)

100% = 完全毁掉

芽后/温室	g ai/ha	看麦娘属	野燕麦	狗尾草属	白芥属
I-1-a-2	250	90	100	100	80
I-1-a-3	250	90	100	100	80
I-1-c-3	250	100	100	100	80
I-1-a-1	250	100	100	100	70

芽后/温室	g ai/ha	甜菜	看麦娘属	野燕麦	稗属	狗尾草属
I-2-a-1	250	0	90	95	100	100

芽后/温室	g ai/ha	甜菜	野燕麦	稗属	狗尾草属	白芥属
I-1-c-1	250	0	90	100	100	70

芽后/温室	g ai/ha	看麦娘属	野燕麦	狗尾草属	猪殃殃属
I-2-c-1	250	90	100	100	80

芽前/温室	g ai/ha	小麦	大豆	马唐属	毒麦	狗尾草属	母菌属
I-1-a-2	60	0	0	100	100	100	95

芽前/温室	g ai/ha	甜菜	看麦娘属	野燕麦	马唐属	藜属
I-1-a-3	125	0	95	100	100	100

芽前/温室	g ai/ha	油菜	看麦娘属	马唐属	毒麦	繁缕属
I-1-c-2	125	0	95	100	100	100

芽前/温室	g ai/ha	小麦	大豆	看麦娘属	毒麦	狗尾草属	繁缕属
I-1-c-3	125	10	0	95	100	100	70

芽前/温室	g ai/ha	大豆	毒麦	狗尾草属	母菌属	繁缕属
I-1-a-1	125	0	100	100	100	100

芽前/温室	g ai/ha	大豆	雀麦属	毒麦	狗尾草属	苘麻属
I-2-a-1	125	0	95	100	100	70

实施例 G

体外试验，测定在微生物中的 ED_{50}

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

事先已将该介质与合适浓度的待测菌的孢子或菌丝混合。

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

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

在波长为 620 nm 下进行光学评价，由不同浓度的测量数据计算与未处理的对照相比，活性化合物抑制真菌生长 50% 的剂量 (ED₅₀)。

活性化合物	微生物	ED ₅₀ -值
实施例 I-1-a-2	<i>Pyricularia oryzae</i>	< 0.1
	小麦壳针孢 (<i>Septoria tritici</i>)	< 0.1
	燕麦黑粉菌 (<i>Ustilago avenae</i>)	< 0.1
实施例 I-2-a-2	<i>Pyricularia oryzae</i>	1.96
	小麦壳针孢	< 0.1
	燕麦黑粉菌	< 0.1
实施例 I-2-a-3	<i>Pyricularia oryzae</i>	< 0.1
	小麦壳针孢	< 0.1
	燕麦黑粉菌	0.1

实施例 II

单丝壳菌 (*Sphaerotheca*)-试验(黄瓜)/保护

溶剂: 24.5 重量份丙酮

24.5 重量份二甲基乙酰胺

乳化剂: 1 重量份烷基-芳基-聚乙二醇醚

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

为了测定保护作用，用活性化合物制剂按照给定用量喷洒植物幼苗。在喷洒液干燥后，用苍耳单丝壳菌 (*Sphaerotheca fuliginea*) 孢子的水悬浮液接种植物，然后将所述植物放在约 23℃ 和相对空气湿度约 70% 的温室中。

接种 7 天后进行评价。其中 0% 表示与对照相当的活性水平，而 100% 表示没有观察到侵袭的活性水平。

活性化合物	活性化合物用量, g/ha	%活性水平
实施例 I-1-a-2	100	100

实施例 I

黑星菌 (*Venturia*)-试验(苹果)/保护

溶剂: 24.5 重量份丙酮

24.5 重量份二甲基乙酰胺

乳化剂: 1 重量份烷基-芳基-聚乙二醇醚

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

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

将所述植物放在约 21℃ 和相对空气湿度约 90% 的温室中。

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

活性化合物	活性化合物用量, g/ha	%活性水平
实施例 I-1-a-2	100	91

实施例 J

链格孢 (*Alternaria*)-试验(西红柿)/保护

溶剂: 24.5 重量份丙酮

24.5 重量份二甲基乙酰胺

乳化剂: 1 重量份烷基-芳基-聚乙二醇醚

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

为了测定保护作用, 用活性化合物制剂按照给定用量喷洒植物幼苗。在喷洒液干燥后, 用马铃薯早疫病链格孢 (*Alternaria solani*) 孢子的水悬浮液接种植物, 然后将所述植物放在约 20℃ 和相对空气湿度约 100% 的接种室中。

接种 3 天后进行评价。其中 0% 表示与对照相当的活性水平，而 100% 表示没有观察到侵袭的活性水平。

活性化合物	活性化合物用量, g/ha	% 活性水平
实施例 I-1-a-2	100	93

实施例 K

葡萄孢 (*Botrytis*)-试验 (菜豆)/保护

溶剂: 24.5 重量份丙酮

24.5 重量份二甲基乙酰胺

乳化剂: 1 重量份烷基-芳基-聚乙二醇醚

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

为了测定保护作用，用活性化合物制剂按照给定用量喷洒植物幼苗。在喷洒液干燥后，在每一叶片上放置 2 个小的带有灰葡萄孢 (*Botrytis cinerea*) 的小片琼脂。将接种的植物放在约 20℃ 和相对空气湿度约 100% 的暗室中。

接种 2 天后评价叶片上的侵袭斑点的大小。其中 0% 表示与对照相当的活性水平，而 100% 表示没有观察到侵袭的活性水平。

活性化合物	活性化合物用量, g/ha	% 活性水平
实施例 I-1-a-2	500	92

实施例 L

临界浓度试验/土壤昆虫-处理转基因植物

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

溶剂: 7 重量份丙酮

乳化剂: 1 重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

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

将所述活性化合物配制品浇到土壤上。对此该配制品中活性化合物的浓度实际不起作用，起决定作用的只是每单位体积的土壤中活性化合物的重量，该重量用 ppm (mg/l) 表示。将所述土壤装到 0.25 l 的

盆中并在 20℃ 保存。

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

实施例 M

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

溶剂: 7 重量份丙酮

乳化剂: 1 重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

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

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

在规定时间内测定昆虫的杀死率。