



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 103415504 B

(45) 授权公告日 2016. 04. 20

(21) 申请号 201280011129. 1

(22) 申请日 2012. 02. 27

(30) 优先权数据

11156415. 9 2011. 03. 01 EP

61/447858 2011. 03. 01 US

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2013. 08. 30

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/EP2012/053289 2012. 02. 27

(87) PCT国际申请的公布数据

W02012/116960 DE 2012. 09. 07

(73) 专利权人 拜耳知识产权有限责任公司

地址 德国蒙海姆

(72) 发明人 G. 博雅克 T. 法里达 R. 菲舍尔

S. 莱尔 A. 施纳特勒尔 T. 奥勒

U. 格根斯 H. 克内 O. 马尔萨姆

(74) 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

司 72001

代理人 石克虎 林森

(51) Int. Cl.

C07D 207/38(2006. 01)

C07D 209/54(2006. 01)

C07D 471/10(2006. 01)

C07D 495/10(2006. 01)

C07D 491/113(2006. 01)

C07D 491/107(2006. 01)

A01N 43/36(2006. 01)

A01N 43/38(2006. 01)

A01N 43/90(2006. 01)

(56) 对比文件

CN 1514829 A, 2004. 07. 21,

CN 1761667 A, 2006. 04. 19,

CN 101346351 A, 2009. 01. 14,

CN 101160051 A, 2008. 04. 09,

WO 2010102758 A2, 2010. 09. 16,

US 6451843 B1, 2002. 09. 17,

CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE.

RN:1027045-70-0. 《STN Registry 数据库》. 2008, RN:1027045-70-0.

审查员 陈晓美

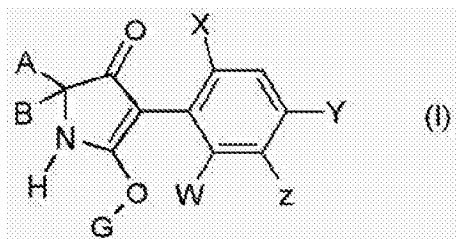
权利要求书3页 说明书92页

(54) 发明名称

2- 酰氧基吡咯啉-4- 酮类化合物

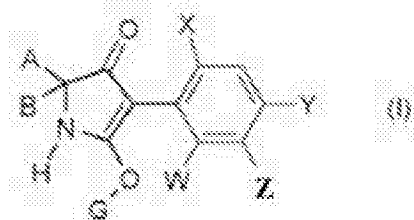
(57) 摘要

备方法及其在植物保护中作为杀昆虫剂和 / 或杀线虫剂和 / 或杀螨剂和 / 或用于抑制不希望的植物生长的用途。



明涉及新的 2- 酰氧基吡咯啉-4- 酮类化合物, 其多种制备方法和中间产物及其作为杀虫剂和 / 或除草剂的应用。此外本发明涉及选择性除草剂, 其一方面包含 2- 酰氧基吡咯啉-4- 酮类化合物且另一方面包含改善作物植物耐受性的化合物。本发明此外涉及通过添加铵盐或磷盐和任选的渗透促进剂提高尤其是包含 2- 酰氧基吡咯啉-4- 酮类化合物的植物保护剂的效果, 涉及相应的药剂、其制

1. 式(I)化合物



其中

W表示甲基、乙基或丙基，

X表示甲基、乙基、氯、溴或甲氧基，

Y表示甲基、氯、碘或溴，

Z表示氢，

A表示甲基，

B表示甲基，

条件是，在当W、X和Y 各自表示甲基或乙基且Z 表示氢时，那么W和X必须各自表示甲基或W和X必须各自表示乙基的情况中，A和B各自仅表示甲基，

A、B和与它们连接的碳原子表示 C₆-环烷基，其任选被甲基、甲氧基或甲氧基甲基取代，其中所述取代基可在环的4-位，

G表示下述基团之一

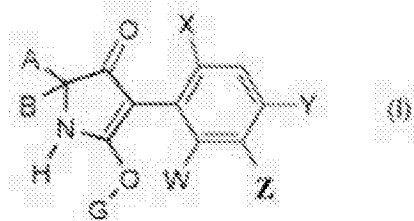


其中

R¹表示甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基，

R²表示甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基。

2. 式(I)化合物，



其中

W表示氢，

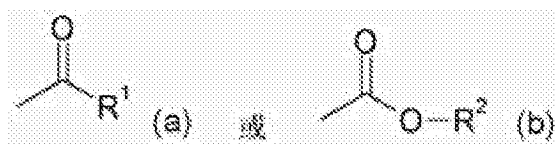
X表示甲基，

Y表示氢，

Z表示甲基，

A、B和与它们连接的碳原子表示 C₆-环烷基，其任选被甲氧基或甲氧基甲基取代，其中所述取代基既可在环的3-位也可在4-位，

G表示下述基团之一



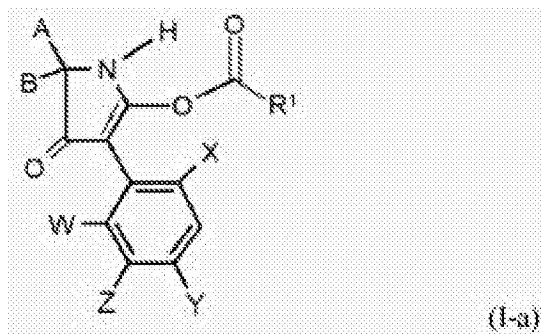
其中

R¹表示甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基，

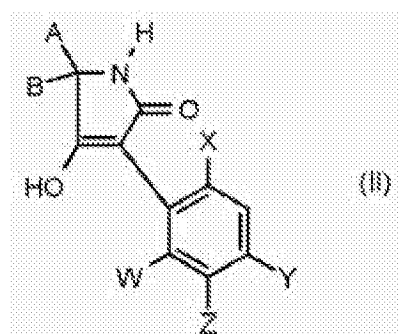
R²表示甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基。

3. 用于制备根据权利要求1的式(I)化合物的方法，其特征在于，

(A) 为获得下式(I-a)的化合物，其中R¹、A、B、W、X、Y和Z 具有在权利要求1中所给出的含义，



任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下，使式(II)化合物，



其中

A、B、W、X、Y和Z 具有在权利要求1中所给出的含义，

α)与式(III)化合物反应



其中

R¹具有在权利要求1中所给出的含义，且

Hal 表示卤素，

或者

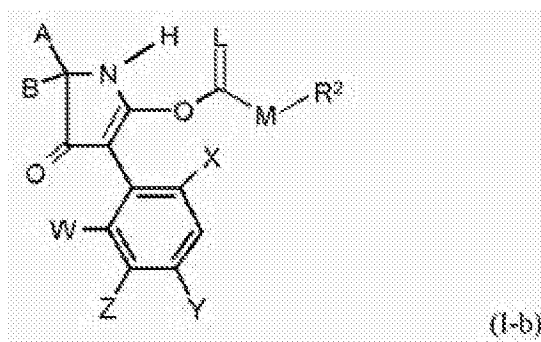
β)与式(IV)的羧酸酐反应



其中

R¹具有在权利要求1中给出的含义；和

(B) 为获得下式(I-b)的化合物,其中 R^2 、A、B、W、X、Y和Z 具有在权利要求1中所给出的含义且L 表示氧,M表示氧,



任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下,使上式(II)的化合物,其中 A、B、W、X、Y和Z 具有在权利要求1中所给出的含义,

与式(V)的氯甲酸酯反应



其中

R^2 具有在权利要求1中所给出的含义,M表示氧。

4. 杀虫剂和/或除草剂,其特征在于含有至少一种根据权利要求1的式(I)化合物。

5. 用于防治动物性害虫和/或不希望的植物植被的方法,其特征在于,使根据权利要求1 的式(I)化合物作用于有害动/植物和/或其生境。

6. 根据权利要求1 的式(I) 化合物用于防治动物性害虫和/或不希望的植物植被的用途。

7. 用于制备杀虫剂和/或除草剂的方法,其特征在于,将根据权利要求1 的式(I) 化合物与填充剂和/或表面活性剂混合。

8. 根据权利要求1 的式(I) 化合物用于制备杀虫剂和/或除草剂的用途。

9. 包含有效含量的活性成分组合物的药剂,作为组分其包含:

(a')至少一种根据权利要求1 的式(I) 化合物,其中A、B、W、X、Y和Z具有在权利要求1中所给出的含义,和

(b')至少一种改善作物植物耐受性的化合物。

10. 用于防治不希望的植物植被的方法,其特征在于,使根据权利要求9 的药剂作用于植物或其环境。

11. 根据权利要求9的药剂用于防治不希望的植物植被的用途。

12. 用于防治不希望的植物植被的方法,其特征在于,使根据权利要求1 的式(I) 化合物和根据权利要求9的改善作物植物耐受性的化合物时间上接近相继地分别作用于植物或其环境。

2-酰氧基吡咯啉-4-酮类化合物

[0001] 本发明涉及新的2-酰氧基吡咯啉-4-酮类化合物,其多种制备方法及其作为杀虫剂和/或除草剂的应用。本发明的主题也是选择性除草剂,其一方面包含2-酰氧基吡咯啉-4-酮类化合物且另一方面包含改善作物植物耐受性的化合物。

[0002] 本发明此外涉及通过添加铵盐或磷盐和任选的渗透促进剂提高尤其是包含2-酰氧基吡咯啉-4-酮类化合物的植物保护剂的效果,涉及相应的药剂、其制备方法及其在植物保护中作为杀昆虫剂和/或杀螨剂和/或杀线虫剂和/或用于抑制不希望的植物生长的应用。

[0003] 已描述了3-酰基吡咯烷-2,4-二酮类化合物具有药学性能(S. Suzuki等人Chem. Pharm. Bull. 15 1120 (1967))。此外,R. Schmierer 和 H. Mildenberger (Liebigs Ann. Chem. 1985, 1095)合成了N-苯基吡咯烷-2,4-二酮类化合物。没有描述该化合物的生物活性。

[0004] EP-A-0 262 399 和 GB-A-2 266 888中公开了类似结构的化合物(3-芳基吡咯烷-2,4-二酮类化合物),但其中尚未已知除草、杀昆虫或杀螨作用。已知具有除草、杀昆虫或杀螨作用的是未被取代的双环3-芳基吡咯烷-2,4-二酮衍生物(EP-A-355 599, EP-A-415 211和JP-A-12-053 670)以及取代的单环3-芳基吡咯烷-2,4-二酮衍生物(EP-A-377 893, EP-A-442 077和WO 10/066780)。

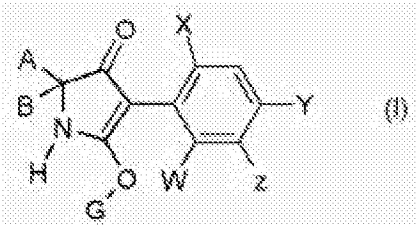
[0005] 此外已知多环3-芳基吡咯烷-2,4-二酮衍生物(EP-A-442 073)和1H-芳基吡咯烷二酮衍生物(EP-A-456 063, EP-A-521 334, EP-A-596 298, EP-A-613 884, EP-A-613 885, WO 95/01 971, WO 95/26 954, WO 95/20 572, EP-A-0 668 267, WO 96/25 395, WO 96/35 664, WO 97/01 535, WO 97/02 243, WO 97/36 868, WO 97/43275, WO 98/05638, WO 98/06721, WO 98/25928, WO 99/24437, WO 99/43649, WO 99/48869, WO 99/55673, WO 01/17972, WO 01/23354, WO 01/74770, WO 03/013249, WO 03/062244, WO 2004/007448, WO 2004/024 688, WO 04/065366, WO 04/080962, WO 04/111042, WO 05/044791, WO 05/044796, WO 05/048710, WO 05/049569, WO 05/066125, WO 05/092897, WO 06/000355, WO 06/029799, WO 06/056281, WO 06/056282, WO 06/089633, WO 07/048545, DEA 102 00505 9892, WO 07/073856, WO 07/096058, WO 07/121868, WO 07/140881, WO 08/067873, WO 08/067910, WO 08/067911, WO 08/138551, WO 09/015801, WO 09/039975, WO 09/049851, WO 09/115262, WO 10/052161, WO 10/102758, WO 10/063378, WO 10/063670, WO 11/098440, WO 11/098443, WO 11/067135, WO 11/067240)。此外由WO 99/16748已知酮缩醇取代的1H-芳基吡咯烷-2,4-二酮类化合物,和由JP-A-14 205 984和Ito M. 等人, Bioscience, Biotechnology and Biochemistry 67, 1230-1238, (2003)已知(螺)-酮缩醇取代的N-烷氧基烷氧基-取代的芳基吡咯烷二酮类化合物。原则上由 WO 03/013249同样已知将安全剂加入酮烯醇中。此外,由WO 06/024411 已知含酮烯醇的除草剂。

[0006] 迄今由WO 2011/098433、DE-A-102010008642、DE-A-102010008643和DE-申请号102010008640已知药学作用。

[0007] 此外已知具有杀真菌作用的联苯取代的1H-吡咯烷二酮衍生物(WO 03/059065)。

[0008] 但是,特别在低的施用量和浓度的情况下,这些化合物的活性和活性谱并非总是完全令人满意的。此外,这些化合物对作物植物的植物耐受性并非总是足够的。此外,这些化合物的毒性特性和/或环境特性并非总是令人满意的。

[0009] 现已发现新的式(I)化合物

[0010]  (I),

[0011] 其中

[0012] W表示氢、卤素、烷基、烯基、炔基、任选取代的环烷基、烷氧基、烯氧基、卤代烷基、卤代烷氧基或氰基,

[0013] X表示卤素、烷基、烯基、炔基、任选取代的环烷基、烷氧基、烯氧基、烷基硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代烯氧基、硝基或氰基,

[0014] Y和Z彼此独立地表示氢、烷基、烯基、炔基、任选取代的环烷基、烷氧基、卤素、卤代烷基、卤代烷氧基、氰基、硝基或在每种情况中任选取代的芳基或杂芳基,

[0015] A表示氢、表示在每种情况中任选被卤素取代的烷基、烯基、烷氧基烷基、烷基硫基烷基,饱和或不饱和的,任选取代的环烷基,其中任选至少一个环原子被杂原子取代,或在每种情况中任选被卤素、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,

[0016] B表示氢、烷基或烷氧基烷基,

[0017] 条件是,如果在W、X和Y各自表示烷基且Z表示氢的情况下,W和X必须各自表示甲基或W和X必须各自表示乙基时,A和B仅允许各自表示甲基,

[0018] 或者

[0019] A和B与它们连接于其上的碳原子一起共同表示饱和或不饱和的,取代的或未被取代的,任选含至少一个杂原子的环,

[0020] G表示下述基团之一

[0021]  (a) 或 (b),

[0022] 其中

[0023] L表示氧或硫,

[0024] M表示氧或硫,

[0025] R¹表示在每种情况中任选被卤素或氰基取代的烷基、烯基、烷氧基烷基、烷基硫基烷基或多烷氧基烷基或表示在每种情况中任选被卤素、烷基或烷氧基取代的环烷基或杂环基或表示在每种情况中任选取代的苯基、苯基烷基、杂芳基、苯氧基烷基或杂芳基氧基烷基,

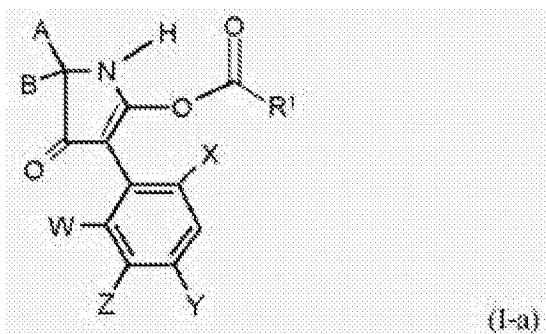
[0026] R²表示在每种情况中任选被卤素或氰基取代的烷基、烯基、烷氧基烷基或多烷氧

基烷基或表示在每种情况中任选取代的环烷基、苯基或苄基。

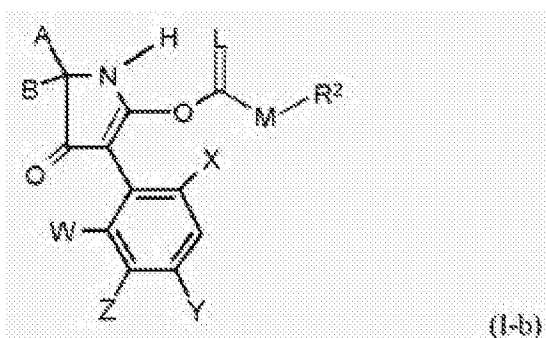
[0027] 取决于取代基的性质,式(I)化合物也可以作为光学异构体或异构体混合物以不同的组成存在,任选可将其以常用的方式分离。纯异构体和异构体混合物,其制备和应用以及包含它们的药剂均是本发明的主题。为简单起见,无论纯化合物和具有任意比例的异构化合物的混合物,在下文中总是称为式(I)化合物。

[0028] 包括组G 的不同含义(a)和(b)在内,产生如下主要结构(I-a) - (I-b),

[0029]



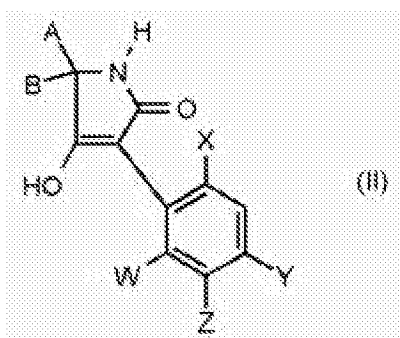
[0030]



[0031] 此外已发现,按照下文中所描述的方法得到新的式(I)化合物:

[0032] (A)任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下,如果将式(II)化合物,其中A、B、W、X、Y和Z 具有上面给出的含义,

[0033]



[0034] 其中

[0035] A、B、W、X、Y和Z 具有上面给出的含义,

[0036] α)与式(III)化合物反应

[0037]



[0038] 其中

[0039] R¹具有上面给出的含义且

[0040] Hal表示卤素（尤其是氯或溴）

[0041] 或

[0042] β)与式(IV)的羧酸酐反应

[0043] $R^1\text{-CO-O-CO-R}^1$ (IV)

[0044] 其中

[0045] R^1 具有上面给出的含义，

[0046] 则得到上式(I-a)化合物，其中 R^1 , A, B, W, X, Y和Z具有上面给出的含义。

[0047] (B)任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下，如果将上示的式(II)化合物，其中 A、B、W、X、Y和Z 具有上面给出的含义，

[0048] 与式(V)的氯甲酸酯或硫代氯甲酸酯反应

[0049] $R^2\text{-M-CO-Cl}$ (V)

[0050] 其中

[0051] R^2 和M 具有上面给出的含义，

[0052] 则得到上示的式(I-b)的化合物，其中 R^2 、A、B、M、W、X、Y和Z 具有上面给出的含义且L 表示氧。

[0053] 此外已发现，新的式(I)化合物具有作为杀虫剂，优选作为杀昆虫剂和/或杀螨剂和/或除草剂的好的活性，此外经常尤其对作物植物具有非常好的植物耐受性和/或具有有利的毒性和/或环境相关性能。

[0054] 令人惊奇地现已发现，在与在下文中描述的改善作物植物耐受性的化合物（安全剂/解毒剂）一起使用时，某些取代的环酮烯醇非常好地避免了对作物植物是伤害，并可特别有利地作为广泛有效的组合制剂在作物植物栽培中，例如在谷物和玉米、油菜、大豆和稻中用于选择性防治不希望的植物。

[0055] 本发明的主题也是包含有效含量活性物质组合物的选择性除草剂，所述活性物质组合物包含下述作为组分

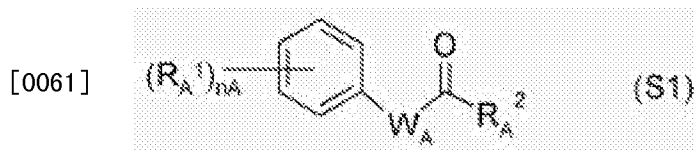
[0056] a')至少一种式(I)化合物，其中 A、B、G、W、X、Y和Z 具有前面给出的含义

[0057] 和

[0058] (b')至少一种改善作物植物-耐受性的化合物（安全剂）。

[0059] 所述安全剂优选选自：

[0060] S1)式(S1)的化合物



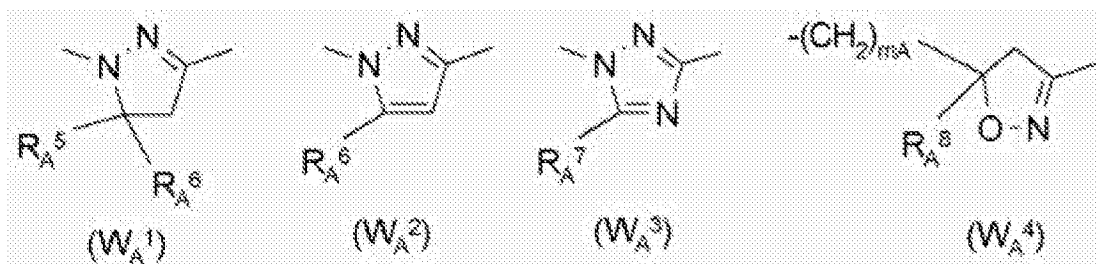
[0062] 其中符号和指数具有下述含义：

[0063] n_A 是 0 - 5 的自然数，优选 0 - 3；

[0064] R_A^1 是卤素、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、硝基或(C₁-C₄)-卤代烷基；

[0065] W_A 是未被取代的或取代的部分饱和或芳族五元杂环的二价杂环残基，其具有 1 - 3 个选自N和O的环上杂原子，其中在环中含至少一个N-原子和最多一个O-原子，优选选自(W_A^1) - (W_A^4)的残基，

[0066]

[0067] m_A 是0或1;

[0068] R_A^2 是 OR_A^3 、 SR_A^3 或 $NR_A^3R_A^4$ 或饱和或不饱和的具有至少一个N-原子和最多3个杂原子的3-7元杂环,所述杂原子优选选自O和S,该杂环经由N-原子与(S1)中的羰基相连,且未被取代或被选自下述的残基取代:(C1-C4)烷基、(C1-C4)烷氧基或任选取代的苯基,优选下式的残基: OR_A^3 、 NHR_A^4 或 $N(CH_3)_2$,特别是 OR_A^3 ;

[0069] R_A^3 是氢或者未被取代的或取代的脂族烃残基,优选具有总共1-18个C-原子;

[0070] R_A^4 是氢、(C1-C6)-烷基、(C1-C6)-烷氧基或者取代的或未被取代的苯基;

[0071] R_A^5 是H、(C1-C8)-烷基、(C1-C8)-卤代烷基、(C1-C4)-烷氧基(C1-C8)-烷基、氰基或 $COOR_A^9$,其中 R_A^9 是氢、(C1-C8)-烷基、(C1-C8)-卤代烷基、(C1-C4)-烷氧基-(C1-C4)-烷基、(C1-C6)-羟基烷基、(C3-C12)-环烷基或三-(C1-C4)-烷基-甲硅烷基;

[0072] R_A^6 、 R_A^7 、 R_A^8 是相同的或不同的,是氢、(C1-C8)-烷基、(C1-C8)-卤代烷基、(C3-C12)-环烷基或者取代的或未被取代的苯基;

[0073] 优选:

[0074] a)二氯苯基吡唑啉-3-甲酸类型的化合物(S1^a),优选化合物如1-(2,4-二氯苯基)-5-(乙氧基羰基)-5-甲基-2-吡唑啉-3-甲酸、1-(2,4-二氯苯基)-5-(乙氧基羰基)-5-甲基-2-吡唑啉-3-甲酸乙酯(S1-1) (“吡唑解草酯(Mefenpyr-diethyl)”),和相关的化合物,如描述在W0-A-91/07874中;

[0075] b)二氯苯基吡唑甲酸的衍生物(S1^b),优选化合物如1-(2,4-二氯苯基)-5-甲基吡唑-3-甲酸乙酯(S1-2)、1-(2,4-二氯苯基)-5-异丙基吡唑-3-甲酸乙酯(S1-3)、1-(2,4-二氯苯基)-5-(1,1-二甲基乙基)吡唑-3-甲酸乙酯(S1-4)和相关的化合物,如描述在EP-A-333 131和EP-A-269 806中;

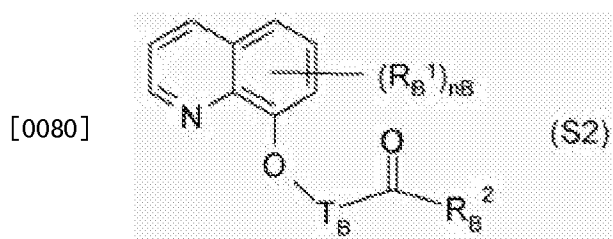
[0076] c)1,5-二苯基吡唑-3-甲酸的衍生物(S1^c),优选化合物如1-(2,4-二氯苯基)-5-苯基吡唑-3-甲酸乙酯(S1-5)、1-(2-氯苯基)-5-苯基吡唑-3-甲酸乙酯(S1-6)和相关的化合物,例如描述在EP-A-268 554中;

[0077] d)三唑甲酸类型的化合物(S1^d),优选化合物如解草唑(-乙酯),即1-(2,4-二氯苯基)-5-三氯甲基-(1H)-1,2,4-三唑-3-甲酸乙酯(S1-7),和相关的化合物如描述在EP-A-174 562和EP-A-346 620中;

[0078] e)5-苄基-或5-苯基-2-异噁唑啉-3-甲酸或5,5-二苯基-2-异噁唑啉-3-甲酸类型的化合物(S1^e),优选化合物如5-(2,4-二氯苄基)-2-异噁唑啉-3-甲酸乙酯(S1-8)或5-苯基-2-异噁唑啉-3-甲酸乙酯(S1-9)和相关的化合物,如描述在W0-A-91/08202中的,或5,5-二苯基-2-异噁唑啉-3-甲酸(S1-10)或5,5-二苯基-2-异噁唑啉-3-甲酸乙酯(S1-11) (“双苯噁唑啉(isoxadifen-ethyl)”)或5,5-二苯基-2-异噁唑啉-3-甲酸正丙酯(S1-12)或5-(4-氟苄基)-5-苯基-2-异噁唑啉-3-甲酸乙酯(S1-13),如专利申请W0-A-95/07897中

所述。

[0079] S2)式 (S2)的喹啉衍生物



[0081] 其中符号和指数具有下述含义：

[0082] R_B^1 是卤素、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、硝基或(C₁-C₄)-卤代烷基；

[0083] n_B 是 0 - 5 的自然数,优选 0 - 3；

[0084] R_B^2 是 OR_B^3 、 SR_B^3 或 $NR_B^3R_B^4$ 或者饱和

[0085] 或不饱和的具有至少一个N-原子和最多3个杂原子的 3 - 7 元杂环,所述杂原子优选选自O和S,该杂环经由N-原子与(S2)中的羰基相连,且未被取代或被选自下述的残基取代:(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷氧基或任选取代的苯基,优选下式的残基: OR_B^3 , NHR_B^4 或 $N(CH_3)_2$,特别是 OR_B^3 ；

[0086] R_B^3 是氢或者未被取代的或取代的脂族烃残基,优选具有总共 1 - 18 个C-原子；

[0087] R_B^4 是氢、(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基或者取代的或未被取代的苯基；

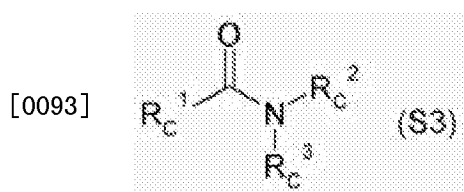
[0088] T_B 是(C₁或C₂)-烷二基链,其未被取代或被一个或两个 (C₁-C₄)-烷基残基或被[(C₁-C₃)-烷氧基]-羰基取代；

[0089] 优选：

[0090] a)8-喹啉氧基乙酸类型的化合物(S2^a),优选 (5-氯-8-喹啉氧基)乙酸-(1-甲基己)酯 (“解毒喹(Cloquintocet-mexyl)”)(S2-1), (5-氯-8-喹啉氧基)乙酸-(1,3-二甲基丁-1-基)酯 (S2-2), (5-氯-8-喹啉氧基)乙酸-4-烯丙氧基丁酯 (S2-3), (5-氯-8-喹啉氧基)乙酸-1-烯丙氧基丙-2-基酯 (S2-4), (5-氯-8-喹啉氧基)乙酸乙酯 (S2-5), (5-氯-8-喹啉氧基)乙酸甲酯 (S2-6), (5-氯-8-喹啉氧基)乙酸烯丙基酯 (S2-7), (5-氯-8-喹啉氧基)乙酸-2-(2-亚丙基亚胺氧基)-1-乙酯 (S2-8), (5-氯-8-喹啉氧基)乙酸-2-氧丙-1-基酯 (S2-9)和相关的化合物,如在EP-A-86 750、EP-A-94 349和EP-A-191 736或EP-A-0 492 366中所述的,以及(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸(S2-10),其水合物和盐,例如其锂盐、钠盐、钾盐、钙盐、镁盐、铝盐、铁盐、铵盐、季铵盐、铊盐或磷盐如在 WO-A-2002/34048中所述的；

[0091] b)(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸类型的化合物(S2^b),优选化合物如 (5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸二乙酯、(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸二烯丙酯、(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸甲酯乙酯和相关的化合物,如在EP-A-0 582 198中所述的。

[0092] S3)式(S3)的化合物



[0094] 其中符号和指数具有下述含义：

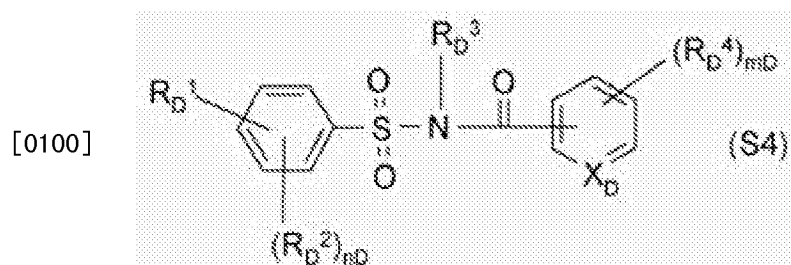
[0095] R_c^1 是(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-卤代烯基、(C₃-C₇)-环烷基,优选二氯甲基;

[0096] R_c^2 , R_c^3 是相同的或不同的,是氢、(C₁-C₄)-烷基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-炔基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₂-C₄)-卤代烯基、(C₁-C₄)-烷基氨基甲酰基-(C₁-C₄)-烷基、(C₂-C₄)-烯基氨基甲酰基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、二氧杂环戊基-(C₁-C₄)-烷基、噻唑基、呋喃基、呋喃基烷基、噻吩基、哌啶基、取代的或未被取代的苯基,或者 R_c^2 和 R_c^3 共同形成取代的或未被取代的杂环环,优选噁唑烷-、噻唑烷-、哌啶-、吗啉-、六氢嘧啶-或苯并噁嗪环;

[0097] 优选:

[0098] 二氯乙酰胺类型的活性物质,经常将其用作芽前安全剂(作用于土壤的安全剂),例如“Dichlormid”(N,N-二烯丙基-2,2-二氯乙酰胺)(S3-1),Stauffer公司的“R-29148”(3-二氯乙酰基-2,2,5-三甲基-1,3-噁唑烷)(S3-2),Stauffer公司的“R-28725”(3-二氯乙酰基-2,2-二甲基-1,3-噁唑烷)(S3-3),“解草酮(Benoxacor)”(4-二氯乙酰基-3,4-二氢-3-甲基-2H-1,4-苯并噁嗪)(S3-4),PPG Industries的“PPG-1292”(N-烯丙基-N-[(1,3-二氧杂戊环-2-基)甲基]二氯乙酰胺)(S3-5),Sagro-Chem的“DKA-24”(N-烯丙基-N-[(烯丙基氨基羰基)甲基]二氯乙酰胺)(S3-6),Nitrokemia或Monsanto的“AD-67”或“MON 4660”(3-二氯乙酰基-1-氧杂-3-氮杂(螺)[4,5]癸烷)(S3-7),TRI-Chemical RT的“TI-35”(1-二氯乙酰基氮杂环庚烷)(S3-8),BASF的“Diclonon”(Dicyclonon)或“BAS145138”或“LAB145138”(S3-9)(3-二氯乙酰基-2,2,5-三甲基-1,3-二氮杂双环[4.3.0]壬烷),“呋喃解草唑(Furilazol)”或“MON 13900”((RS)-3-二氯乙酰基-5-(2-呋喃基)-2,2-二甲基噁唑烷)(S3-10);及其(R)-异构体(S3-11)。

[0099] S4)式(S4)的N-酰基磺胺类化合物及其盐,



[0101] 其中符号和指数具有下述含义:

[0102] X_D 是CH或N;

[0103] R_D^1 是CO-NR_D⁵R_D⁶或NHCO-R_D⁷;

[0104] R_D^2 是卤素、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基、硝基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基、(C₁-C₄)-烷氧基羰基或(C₁-C₄)-烷基羰基;

[0105] R_D^3 是氢、(C₁-C₄)-烷基、(C₂-C₄)-烯基或(C₂-C₄)-炔基;

[0106] R_D^4 是卤素、硝基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基、(C₃-C₆)-环烷基、苯基、(C₁-C₄)-烷氧基、氰基、(C₁-C₄)-烷基硫基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基、(C₁-C₄)-烷氧基羰基或(C₁-C₄)-烷基羰基;

[0107] R_D^5 是氢、(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₅-C₆)-环烯基、苯基或含 v_D 个杂原子的3 - 6元杂环基,所述杂原子选自氮、氧和硫,其中最后提及

的7种残基被 v_D 个选自下述的取代基取代:卤素、 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基、 (C_1-C_2) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_2) -烷基磺酰基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基羰基、 (C_1-C_4) -烷基羰基和苯基,且在环状残基的情况中也被 (C_1-C_4) -烷基和 (C_1-C_4) -卤代烷基取代;

[0108] R_D^6 是氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -烯基或 (C_2-C_6) -炔基,其中最后提及的3种残基被 v_D 个选自下述的取代基取代:卤素、羟基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基和 (C_1-C_4) -烷基硫基,或

[0109] R_D^5 和 R_D^6 与带有它们的N-原子一起形成吡咯烷基-或哌啶基残基;

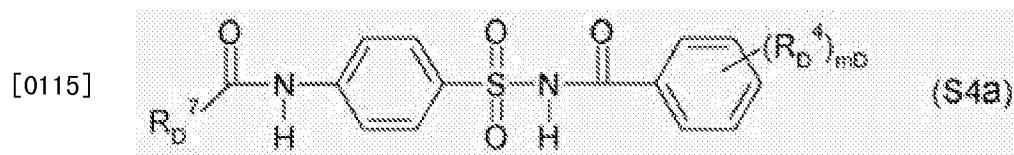
[0110] R_D^7 是氢、 (C_1-C_4) -烷基氨基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基,其中最后提及的2种残基被 v_D 个选自下述的取代基取代:卤素、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基和 (C_1-C_4) -烷基硫基,且在环状残基的情况中也被 (C_1-C_4) -烷基和 (C_1-C_4) -卤代烷基取代;

[0111] n_D 是0、1或2;

[0112] m_D 是1或2;

[0113] v_D 是0、1、2或3;

[0114] 其中,优选的是 N-酰基磺胺类型的化合物,例如下式 ($S4^a$) 的化合物,其例如由 WO-A-97/45016 已知



[0116] 其中

[0117] R_D^7 是 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基,其中最后提及的2种残基被 v_D 个选自下述的取代基取代:卤素、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基和 (C_1-C_4) -烷基硫基,且在环状残基的情况中也被 (C_1-C_4) -烷基和 (C_1-C_4) -卤代烷基取代;

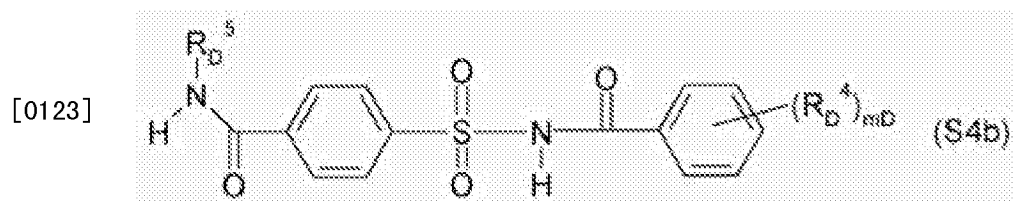
[0118] R_D^4 是卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 CF_3 ;

[0119] m_D 是1或2;

[0120] v_D 表示0、1、2或3;

[0121] 以及

[0122] 酰基氨基磺酰基苯甲酰胺,例如下式 ($S4^b$) ,其例如由 WO-A-99/16744 已知,



[0124] 例如在这些中

[0125] R_D^5 = 环丙基和 (R_D^4) = 2-OMe ("环丙磺酰胺", $S4-1$),

[0126] R_D^5 = 环丙基和 (R_D^4) = 5-Cl-2-OMe ($S4-2$),

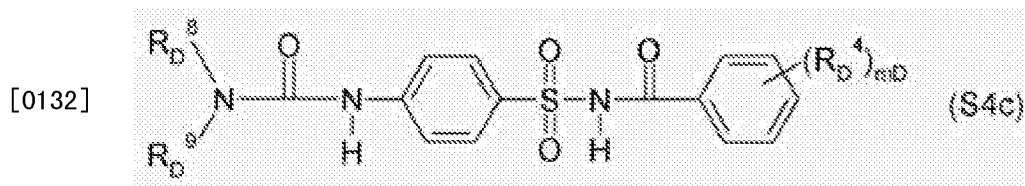
[0127] R_D^5 = 乙基和 (R_D^4) = 2-OMe ($S4-3$),

[0128] R_D^5 = 异丙基和 (R_D^4) = 5-Cl-2-OMe ($S4-4$) 和

[0129] R_D^5 = 异丙基和 (R_D^4) = 2-OMe ($S4-5$)

[0130] 以及

[0131] 式(S4^c)的N-酰基氨磺酰基苯基脲类型的化合物,其例如由 EP-A-365484已知,



[0133] 其中

[0134] R_D⁸和R_D⁹彼此独立地表示氢、(C₁-C₈)-烷基、(C₃-C₈)-环烷基、(C₃-C₆)-烯基、(C₃-C₆)-炔基,

[0135] R_D⁴表示卤素、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、CF₃

[0136] m_D表示1或2;

[0137] 例如

[0138] 1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨磺酰基)苯基]-3-甲基脲,

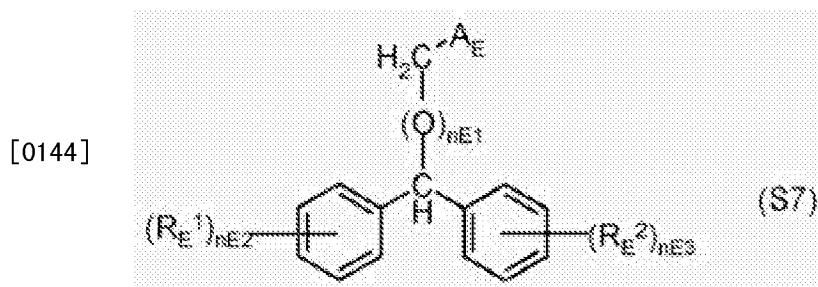
[0139] 1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨磺酰基)苯基]-3,3-二甲基脲,

[0140] 1-[4-(N-4,5-二甲基苯甲酰基氨磺酰基)苯基]-3-甲基脲。

[0141] S5)羟基芳族化合物和芳族-脂族羧酸衍生物类的活性物质(S5),例如3,4,5-三乙酰氧基苯甲酸乙酯、3,5-二甲氧基-4-羟基苯甲酸、3,5-二羟基苯甲酸、4-羟基水杨酸、4-氟水杨酸、2-羟基肉桂酸、1,2-二氢-2-氧-6-三氟甲基吡啶-3-甲酰胺、2,4-二氯肉桂酸,如其描述于 WO-A-2004/084631、WO-A-2005/015994、WO-A-2005/016001中。

[0142] S6)1,2-二氢喹啉-2-酮类的活性物质(S6),例如 1-甲基-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹啉-2-酮、1-甲基-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹啉-2-硫酮、1-(2-氨基乙基)-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹啉-2-酮-盐酸盐、1-[2-(二乙基氨基)乙基]-6,7-二甲基-3-噻吩-2-基喹啉-2(1H)-酮、1-(2-甲基磺酰基氨基乙基)-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹啉-2-酮,如其描述于WO-A-2005/112630中。

[0143] S7)式(S7)的化合物,如其描述于WO-A-1998/38856中,



[0145] 其中符号和指数具有下述含义:

[0146] R_E¹、R_E²彼此独立地表示卤素、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-烷基氨基、二-(C₁-C₄)-烷基氨基、硝基;

[0147] A_E是COOR_E³或COSR_E⁴

[0148] R_E³、R_E⁴彼此独立地表示氢、(C₁-C₄)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₄)-炔基、氰基烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、苯基、硝基苯基、苄基、卤代苄基、吡啶基烷基和烷基铵,

[0149] n_E¹是 0或1

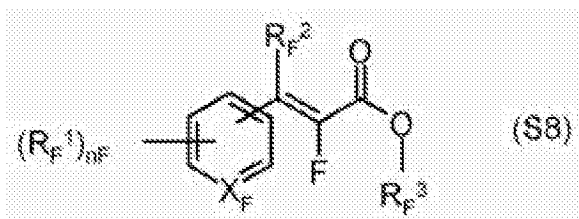
[0150] n_E²、n_E³彼此独立地是0、1或2,

[0151] 优选:

[0152] 二苯基甲氧基乙酸、二苯基甲氧基乙酸乙酯、二苯基甲氧基乙酸甲酯 (CAS 登记号 41858-19-9) (S7-1)。

[0153] S8)式(S8)的化合物或其盐,如其描述于W0-A-98/27049中,

[0154]



[0155] 其中

[0156] X_F是CH或N,

[0157] n_F在X_F=N的情况中是0 - 4 的整数,和

[0158] 在X_F=CH的情况中是0 - 5 的整数,

[0159] R_F¹是卤素、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基、硝基、(C₁-C₄)-烷基硫基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基、(C₁-C₄)-烷氧基羰基、任选取代的苯基、任选取代的苯氧基,

[0160] R_F²是氢或(C₁-C₄)-烷基

[0161] R_F³是氢、(C₁-C₈)-烷基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-炔基、或芳基,其中每个上述含碳残基未被取代或被一个或多个、优选最多三个相同或不同的选自卤素和烷氧基的残基取代,

[0162] 优选下述的化合物或其盐,其中

[0163] X_F是CH,

[0164] n_F是0 - 2 的整数,

[0165] R_F¹是卤素、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基,

[0166] R_F²是氢或(C₁-C₄)-烷基,

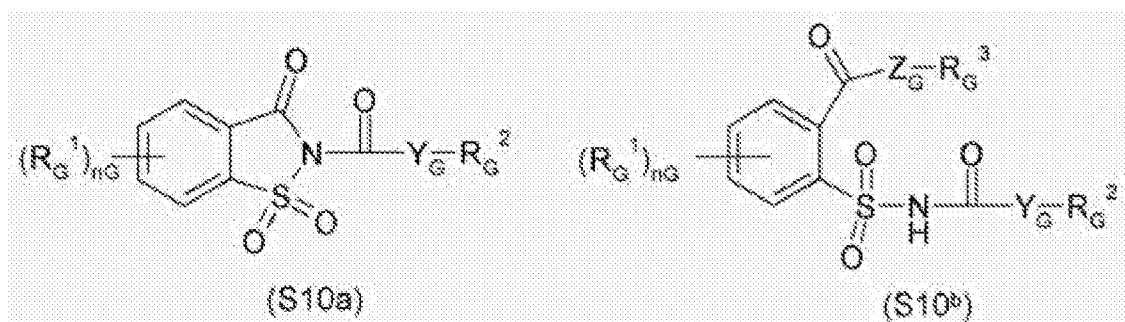
[0167] R_F³是氢、(C₁-C₈)-烷基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-炔基、或芳基,其中每个上述含碳残基未被取代或被一个或多个、优选最多三个相同或不同的选自卤素和烷氧基的残基取代。

[0168] S9)3-(5-四唑基羰基)-2-喹诺酮类的活性物质(S9),例如1,2-二氢-4-羟基-1-乙基-3-(5-四唑基羰基)-2-喹诺酮 (CAS 登记号 219479-18-2)、1,2-二氢-4-羟基-1-甲基-3-(5-四唑基羰基)-2-喹诺酮 (CAS 登记号 95855-00-8),如其描述于W0-A-1999/000020中。

[0169] S10)式 (S10^a)或(S10^b)的化合物

[0170] 如其描述于W0-A-2007/023719和W0-A-2007/023764中,

[0171]



[0172] 其中

[0173] R_G^1 是卤素、 (C_1-C_4) -烷基、甲氧基、硝基、氰基、 CF_3 、 OCF_3 ,

[0174] Y_G, Z_G 彼此独立地表示O或S,

[0175] n_G 是0- 4的整数,

[0176] R_G^2 是 (C_1-C_{16}) -烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_3-C_6) -环烷基、芳基;苄基、卤代苄基,

[0177] R_G^3 是氢或 (C_1-C_6) -烷基。

[0178] S11)氧亚氨基-化合物类型的活性物质 (S11),其作为拌种剂已知,例如“解草腈(Oxabetrinil)”((Z)-1,3-二氧杂戊环基甲氧基亚氨基(苯基)乙腈) (S11-1),其已知为用于稷免受异丙甲草胺伤害的拌种剂-安全剂,

[0179] “氟草肟(Fluxofenim)” (1-(4-氯苯基)-2,2,2-三氟-1-乙酮-0-(1,3-二氧杂戊环-2-基甲基)肟) (S11-2),其已知为用于稷免受异丙甲草胺伤害的拌种剂-安全剂,和

[0180] “解草胺腈(Cyometrinil)”或“CGA-43089” ((Z)-氰基甲氧基亚氨基(苯基)乙腈) (S11-3),其已知为用于稷免受异丙甲草胺伤害的拌种剂-安全剂。

[0181] S12)活性物质异硫代二氢苯并吡喃酮 (S12),例如 [(3-氧-1H-2-苯并噻喃-4(3H)-亚基)甲氧基]乙酸甲酯 (CAS 登记号 205121-04-6) (S12-1)和WO-A-1998/13361的相关化合物。

[0182] S13)组 (S13)的一种或多种化合物:

[0183] “萘二甲酸酐” (1,8-萘二甲酸酐) (S13-1),其已知为用于玉米免受硫代氨基甲酸酯除草剂伤害的拌种剂-安全剂,

[0184] “解草啶(Fenclorim)” (4,6-二氯-2-苯基嘧啶) (S13-2) 其已知在已播种的稻中作为丙草胺(Pretilachlor)的安全剂,

[0185] “解草胺(Flurazole)” (2-氯-4-三氟甲基-1,3-噻唑-5-甲酸苄酯) (S13-3) 其已知为用于稷免受甲草胺和异丙甲草胺伤害的拌种剂-安全剂,

[0186] American Cyanamid 公司的“CL 304415” (CAS 登记号 31541-57-8) (4-羧基-3,4-二氢-2H-1-苯并吡喃-4-乙酸) (S13-4),其已知为用于玉米免受咪唑啉酮类伤害的安全剂,

[0187] Nitrokemia 公司的“MG 191” (CAS 登记号 96420-72-3) (2-二氯甲基-2-甲基-1,3-二氧杂戊环) (S13-5),已知为玉米的安全剂,

[0188] Nitrokemia 公司的“MG-838” (CAS 登记号 133993-74-5) (1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷-4-二硫代羧酸-2-丙烯基) (S13-6),

[0189] “乙拌磷(Disulfoton)” (0,0- 二乙基S-2- 乙硫基乙基二硫代磷酸酯) (S13-7),

[0190] “增效磷(Dietholate)” (0,0-二乙基 0-苯基硫代磷酸酯) (S13-8),

[0191] “Mephenate” (甲基氨基甲酸-4-氯苯酯) (S13-9)。

[0192] S14)除了针对有害植物的除草作用以外还对作物植物(如稻)具有安全剂作用的活性物质,例如,“哌草丹(Dimepiperate)”或“MY-93”(S-1-甲基-1-苯基乙基哌啶-1-硫代羧酸酯),其已知作为安全剂用于稻来抵抗禾草敌(Molinate)除草剂的损害,

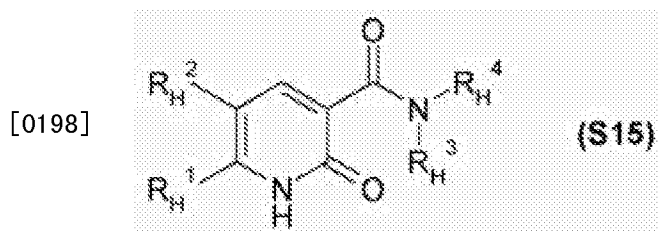
[0193] “杀草隆(Daimuron)”或“SK 23”(1-(1-甲基-1-苯基乙基)-3-对甲苯基脲),其已知作为安全剂用于稻来抵抗除草剂唑吡啶磺隆(Imazosulphuron)的损害,

[0194] “苄草隆(Cumyluron)”=“JC-940”(3-(2-氯苯基甲基)-1-(1-甲基-1-苯基乙基)脲,见JP-A-60087254),其已知作为安全剂用于稻来抵抗一些除草剂的损害,

[0195] “苯草酮(Methoxyphenone)”或“NK 049”(3,3'-二甲基-4-甲氧基二苯甲酮),其已知作为安全剂用于稻来抵抗一些除草剂的损害,

[0196] Kumiai 的“CSB”(1-溴-4-(氯甲基磺酰基)苯),(CAS 登记号54091-06-4),其已知作为安全剂用于抵抗稻中一些除草剂的损害。

[0197] S15)式(S15)的化合物或其互变异构体



[0199] 如其描述于 WO-A-2008/131861和WO-A-2008/131860中

[0200] 其中

[0201] R_H^1 是(C₁-C₆)-卤代烷基残基且

[0202] R_H^2 是氢或卤素,且

[0203] R_H^3 、 R_H^4 彼此独立地表示氢、(C₁-C₁₆)-烷基、(C₂-C₁₆)-烯基或(C₂-C₁₆)-炔基,

[0204] 其中最后提及的3种残基的每一种是未被取代的或被一个或多个选自下述的残基取代:卤素、羟基、氰基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基、(C₁-C₄)-烷基硫基、(C₁-C₄)-烷基氨基、二[(C₁-C₄)-烷基]氨基、[(C₁-C₄)-烷氧基]羰基、[(C₁-C₄)-卤代烷氧基]羰基、未取代的或取代的(C₃-C₆)-环烷基、未取代的或取代的苯基、和未取代的或取代的杂环基,

[0205] 或是(C₃-C₆)-环烷基、(C₄-C₆)-环烯基、在环的一侧与4-6元饱和或不饱和碳环稠合的(C₃-C₆)-环烷基或在环的一侧与4-6元饱和或不饱和碳环稠合的(C₄-C₆)-环烯基,

[0206] 其中最后提及的4种残基的每一种是未被取代的或被一个或多个选自下述的残基取代:卤素、羟基、氰基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基、(C₁-C₄)-烷基硫基、(C₁-C₄)-烷基氨基、二[(C₁-C₄)-烷基]氨基、[(C₁-C₄)-烷氧基]羰基、[(C₁-C₄)-卤代烷氧基]羰基、未取代的或取代的(C₃-C₆)-环烷基、未取代的或取代的苯基、和未取代的或取代的杂环基,

[0207] 或者

[0208] R_H^3 是(C₁-C₄)-烷氧基、(C₂-C₄)-烯氧基、(C₂-C₆)-炔氧基或(C₂-C₄)-卤代烷氧基且

[0209] R_H^4 是氢或(C₁-C₄)-烷基或

[0210] R_H^3 和 R_H^4 与直连的N-原子一起表示一个4-8元杂环,其除了该N-原子而外也可包含

另外的环上杂原子,优选最多2个选自N、O和S的另外的环上杂原子,且该杂环是未取代的或被一个或多个下述残基取代的:卤素、氰基、硝基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基和(C₁-C₄)-烷基硫基。

[0211] S16)主要用作除草剂,但对作物植物也具有安全剂作用的活性物质,例如

[0212] (2,4-二氯苯氧基)乙酸(2,4-D),

[0213] (4-氯苯氧基)乙酸,

[0214] (R,S)-2-(4-氯-邻甲苯基氧基)丙酸(2-甲-4-氯丙酸(Mecoprop)),

[0215] 4-(2,4-二氯苯氧基)丁酸(2,4-DB),

[0216] (4-氯-邻甲苯基氧基)乙酸(MCPA),

[0217] 4-(4-氯-邻甲苯基氧基)丁酸,

[0218] 4-(4-氯苯氧基)丁酸,

[0219] 3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸(麦草畏(Dicamba)),

[0220] 3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸-1-(乙氧基羰基)乙酯(Lactidichlor-ethyl)。

[0221] 最优选作为改善作物植物耐受性的化合物[组分(b')]为解毒唑、解草唑、双苯噁唑酸、吡唑解草酯、解草啉、苄草隆、S4-1 和S4-5,其中特别强调解毒唑和吡唑解草酯。

[0222] 现已令人惊奇地发现,上文定义的通式(I) 化合物与选自上文所列的组(b') 的安全剂(解毒剂)的活性物质组合物在非常好的有用植物耐受性的同时也具有特别高的除草效果,并且可用于不同作物,尤其是用于谷类(特别是小麦),以及用于大豆、马铃薯、玉米和稻中以选择性防治杂草。

[0223] 在此被认为令人惊奇的是,在众多已知的能够对抗除草剂对作物植物的损害作用的安全剂或解毒剂中,恰恰是上文所列的组(b') 的化合物适于几乎完全抵消除式(I) 化合物对作物植物的损害作用,而同时没有明显地减退对杂草的除草效果。

[0224] 在此可强调选自组(b') 的特别优选的和最优选的组合物参与物的特别有利的作用,特别是在作为作物植物的谷类植物,例如小麦、大麦和黑麦、以及玉米和稻的保护方面。

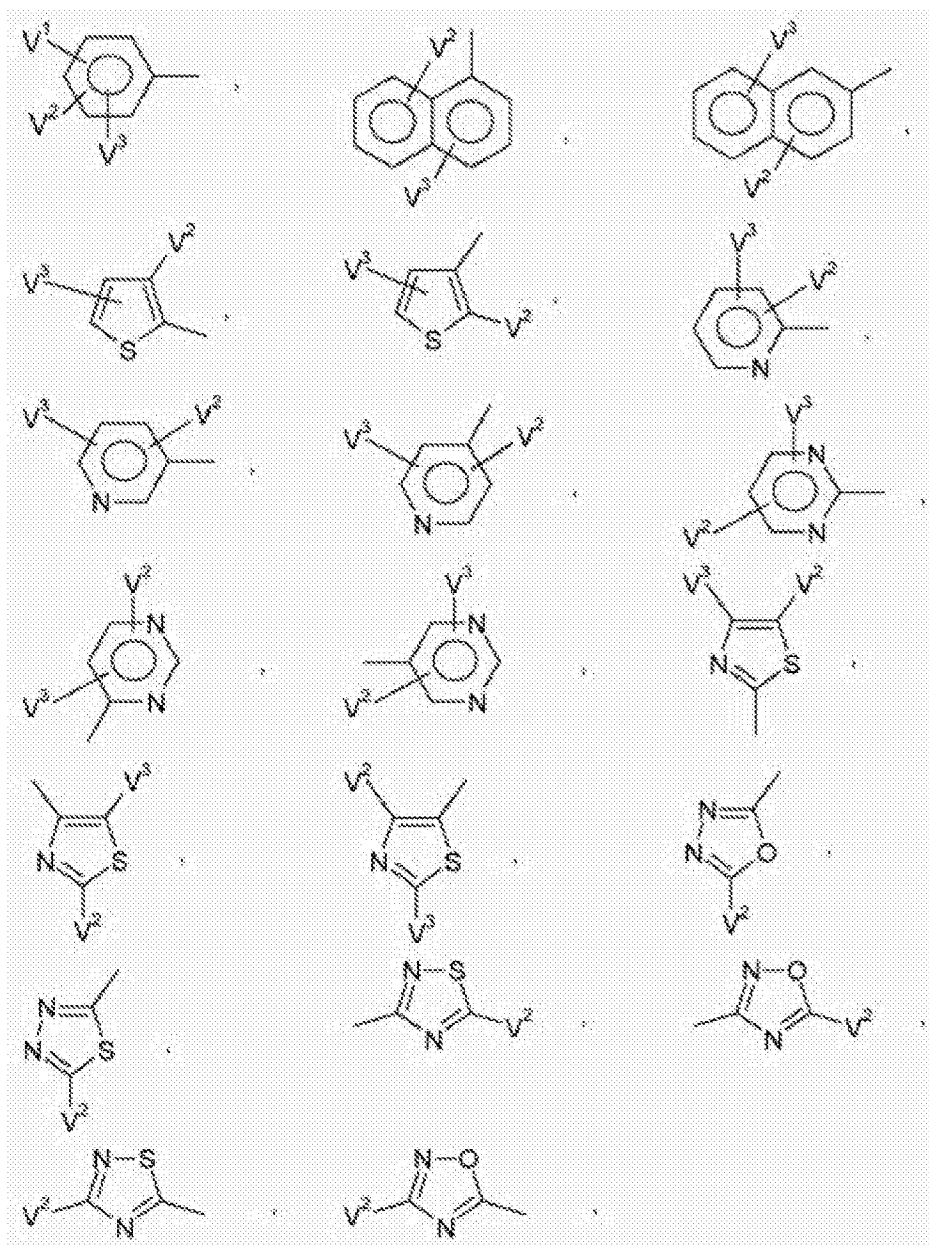
[0225] 本发明的化合物通过式(I) 来一般性定义。上文和下文中提及的式子中所提及的残基的优选取代基和范围解释如下:

[0226] W优选表示氢,卤素,C₁-C₆-烷基,C₂-C₆-烯基,C₂-C₆-炔基,任选被下述取代基单至二取代的C₃-C₆-环烷基:C₁-C₂-烷基、C₁-C₂-烷氧基、氟、氯、三氟甲基或C₃-C₆-环烷基,C₁-C₆-烷氧基,C₁-C₄-卤代烷基,C₁-C₄-卤代烷氧基或氰基,

[0227] X优选表示卤素,C₁-C₆-烷基,C₂-C₆-烯基,C₂-C₆-炔基,任选被下述取代基单至二取代的C₃-C₆-环烷基:C₁-C₂-烷基、C₁-C₂-烷氧基、氟、氯、三氟甲基或C₃-C₆-环烷基,C₁-C₆-卤代烷基,C₁-C₆-烷氧基,C₃-C₆-烯氧基,C₁-C₆-烷基硫基,C₁-C₆-烷基亚磺酰基,C₁-C₆-烷基磺酰基,C₁-C₆-卤代烷氧基,C₃-C₆-卤代烯氧基,硝基或氰基,

[0228] Y和Z 优选彼此独立地表示氢,卤素,C₁-C₆-烷基,C₂-C₆-烯基,C₂-C₆-炔基,任选被下述取代基单至二取代的C₃-C₆-环烷基:C₁-C₂-烷基、C₁-C₂-烷氧基、氟、氯、三氟甲基或C₃-C₆-环烷基,C₁-C₆-烷氧基,C₁-C₄-卤代烷基,C₁-C₆-卤代烷氧基,氰基,C₂-C₆-烯基,C₂-C₆-炔基或表示下述(杂)-芳基残基之一:

[0229]



[0230] 其中在 (杂)-芳基的情况中,仅允许残基 Y或Z之一表示(杂)-芳基,

[0231] V¹优选表示氢、卤素、C₁-C₁₂-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷基硫基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-卤代烷氧基、硝基、氰基或表示苯基、苯氧基、苯氧基-C₁-C₄-烷基、苯基-C₁-C₄-烷氧基、苯基硫基-C₁-C₄-烷基或苯基-C₁-C₄-烷基硫基,它们在每种情况中被下述取代基任选单或多取代:卤素、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-卤代烷氧基、硝基或氰基,

[0232] V²和V³ 优选彼此独立地表示氢、卤素、C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基或C₁-C₄-卤代烷氧基,

[0233] A优选表示氢或在每种情况中任选被卤素取代的C₁-C₁₂-烷基、C₃-C₈-烯基、C₁-C₁₀-烷氧基-C₁-C₈-烷基、C₁-C₁₀-烷基硫基-C₁-C₆-烷基,任选被卤素、C₁-C₆-烷基或C₁-C₆-烷氧基取代的C₃-C₈-环烷基,其中任选一个或两个非直接相邻的环成员被氧和/或硫替代,或者表示苯基、萘基、具有5-6个环原子的杂芳基(例如呋喃基、吡啶基、咪唑基、三唑基、吡唑基、噻

啶基、噻唑基或噻吩基)、苯基-C₁-C₆-烷基或萘基-C₁-C₆-烷基,其各自任选被下述取代基取代:卤素、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、氰基或硝基,

[0234] B优选表示氢、C₁-C₁₂-烷基或C₁-C₈-烷氧基-C₁-C₆-烷基,

[0235] 条件是,如果在W、X和Y各自表示C₁-C₆-烷基且Z表示氢的情况下,W和X必须各自表示甲基或W和X必须各自表示乙基时,A和B仅允许各自表示甲基,

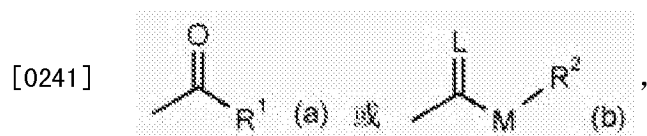
[0236] 或者

[0237] A、B和它们连接的碳原子优选表示饱和的 C₃-C₁₀-环烷基或不饱和的 C₅-C₁₀-环烷基,其中任选一个环成员被氮、氧或硫替代并且其任选被下述基团单或二取代:C₁-C₈-烷基、C₁-C₈-烷氧基、C₃-C₈-烯氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₂-烷氧基、C₃-C₁₀-环烷基、C₁-C₈-卤代烷基 C₂-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₄-烷氧基,其中上述残基(三氟甲基除外)也适合作为N-取代基,或者

[0238] A、B和它们连接的碳原子优选表示 C₃-C₆-环烷基,其被任选包含一个或两个不直接相邻的氧和/或硫原子的任选被C₁-C₄-烷基取代的亚烷基二基或被亚烷基二氧基或被亚烷基二硫基取代,其与和它们连接的碳原子一起形成另一个五-至八元环,或者

[0239] A、B和与它们连接的碳原子优选表示C₃-C₈-环烷基或者C₅-C₈-环烯基,其中两个取代基与和它们连接的碳原子一起表示各自任选被C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基或卤素取代的C₂-C₆-烷二基、C₂-C₆-烯二基或C₄-C₆-二烯二基,其中任选一个亚甲基被氧或者硫替代,

[0240] G优选表示下述基团之一



[0242] 其中

[0243] L表示氧或硫,

[0244] M表示氧或硫,

[0245] R¹优选表示各自任选被卤素或氰基取代的C₁-C₂₀-烷基、C₂-C₂₀-烯基、C₁-C₈-烷氧基-C₁-C₈-烷基、C₁-C₈-烷基硫基-C₁-C₈-烷基或多-C₁-C₈-烷氧基-C₁-C₈-烷基或表示任选被卤素、C₁-C₆-烷基或C₁-C₆-烷氧基取代的C₃-C₈-环烷基,其中任选一个或两个不直接相邻的亚甲基被氧和/或硫替代,

[0246] 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-烷基硫基或C₁-C₆-烷基磺酰基取代的苯基,

[0247] 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,

[0248] 表示任选被卤素或C₁-C₆-烷基取代的具有一个或两个杂原子的5-或6-元杂芳基,所述杂原子选自氧、硫和氮,

[0249] 表示任选被卤素或C₁-C₆-烷基取代的苯氧基-C₁-C₆-烷基或者

[0250] 表示任选被卤素、氨基或C₁-C₆-烷基取代的具有一个或两个杂原子的5-或6-元杂芳基氧基-C₁-C₆-烷基,所述杂原子选自氧、硫和氮,

[0251] R²优选表示各自任选被卤素或氰基取代的C₁-C₂₀-烷基、C₂-C₂₀-烯基、C₁-C₈-烷氧基-C₂-C₈-烷基或多-C₁-C₈-烷氧基-C₂-C₈-烷基,

[0252] 表示任选被卤素、C₁-C₆-烷基或C₁-C₆-烷氧基取代的C₃-C₈-环烷基或

[0253] 表示各自任选被卤素、氰基、硝基、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或苄基。

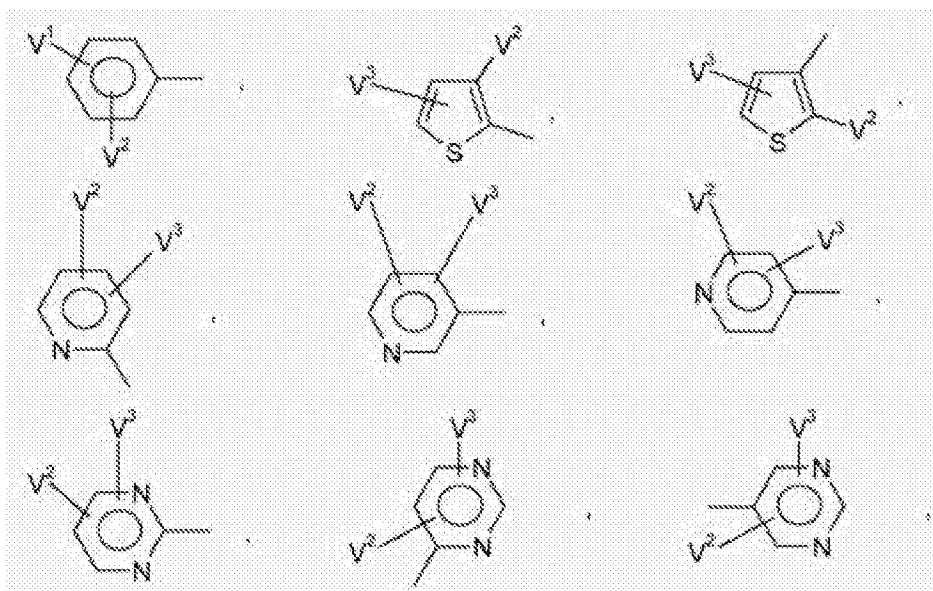
[0254] 在这些作为优选提及的残基定义中卤素表示氟、氯、溴和碘，尤其表示氟、氯和溴。

[0255] W特别优选表示氢，氯，溴，C₁-C₄-烷基，C₂-C₄-烯基，C₂-C₄-炔基，任选被甲基、乙基、甲氧基、氟、氯、三氟甲基或环丙基单取代的C₃-C₆-环烷基，C₁-C₄-烷氧基，C₁-C₂-卤代烷基或C₁-C₂-卤代烷氧基，

[0256] X特别优选表示氯，溴，碘，C₁-C₄-烷基，C₂-C₄-烯基，C₂-C₄-炔基，任选被甲基、乙基、甲氧基、氟、氯、三氟甲基或环丙基单取代的C₃-C₆-环烷基，C₁-C₄-烷氧基，C₁-C₄-卤代烷基，C₁-C₄-卤代烷氧基或氰基，

[0257] Y和Z 特别优选彼此独立地表示氢，氟，氯，溴，碘，C₁-C₄-烷基，C₂-C₄-烯基，C₂-C₄-炔基，任选被甲基、乙基、甲氧基、氟、氯、三氟甲基或环丙基单取代的C₃-C₆-环烷基，C₁-C₆-烷氧基，C₁-C₄-卤代烷基，C₁-C₄-卤代烷氧基、氰基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基或表示下述(杂)-芳基残基之一，

[0258]



[0259] 其中在(杂)-芳基的情况中，仅允许残基 Y或Z之一表示(杂)-芳基，

[0260] V¹特别优选表示氢、氟、氯、溴、C₁-C₆-烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₂-卤代烷基、C₁-C₂-卤代烷氧基、硝基、氰基或任选被下述基团单至二取代的苯基：氟、氯、溴、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₂-卤代烷基、C₁-C₂-卤代烷氧基、硝基或氰基，

[0261] V²和V³ 特别优选彼此独立地表示氢、氟、氯、溴、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₂-卤代烷基或C₁-C₂-卤代烷氧基，

[0262] A特别优选表示氢，各自任选被氟或氯单-三取代的C₁-C₆-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₂-烷基，任选被C₁-C₂-烷基或C₁-C₂-烷氧基单或二取代且任选被氧原子间断的C₃-C₆-环烷基，或各自任选被下述基团单至二取代的苯基、吡啶基或苄基：氟、氯、溴、C₁-C₄-烷基、C₁-C₂-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₂-卤代烷氧基、氰基或硝基，

[0263] B特别优选表示氢、C₁-C₄-烷基或C₁-C₂-烷氧基-C₁-C₂-烷基，

[0264] 条件是，如果在W、X和Y 各自表示C₁-C₄-烷基且Z 表示氢的情况中，W和X必须各自

表示甲基或W和X必须各自表示乙基时,A和B仅允许各自表示甲基,

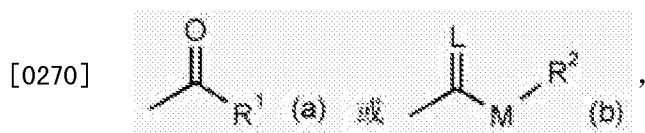
[0265] 或

[0266] A、B和它们连接的碳原子特别优选表示饱和或不饱和的 C₃-C₇-环烷基,其中任选一个环成员被氮、氧或硫替代并且其任选被下述基团单至二取代:C₁-C₆-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₂-烷基、三氟甲基、C₁-C₆-烷氧基、C₃-C₆-烯氧基、三氟乙氧基、C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷氧基或C₃-C₆-环烷基甲氧基,其中上述残基(三氟甲基除外)也适合作为N-取代基,或

[0267] A、B和它们连接的碳原子特别优选表示 C₅-C₆-环烷基,其被任选包含一个或两个不直接相邻的氧和/或硫原子的任选被甲基或乙基取代的亚烷基二基或被亚烷基二氧基或被亚烷基二硫基取代,其与和它们连接的碳原子一起形成另一个五-或六元环,或者

[0268] A、B和与它们连接的碳原子特别优选表示C₃-C₆-环烷基或者C₅-C₆-环烯基,其中两个取代基与和它们连接的碳原子一起表示各自任选被C₁-C₂-烷基或C₁-C₂-烷氧基取代的C₂-C₄-烷二基、C₂-C₄-烯二基或丁二烯二基,

[0269] G特别优选表示下述基团之一



[0271] 其中

[0272] L表示氧或硫,

[0273] M表示氧或硫,

[0274] R¹特别优选表示各自任选被氟或氯单至三取代的C₁-C₁₆-烷基、C₂-C₁₆-烯基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₆-烷基硫基-C₁-C₄-烷基或多-C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₄-烷基或表示任选被氟、氯、C₁-C₅-烷基或C₁-C₅-烷氧基单至二取代的C₃-C₇-环烷基,其中任选一个或两个不直接相邻的亚甲基被氧和/或硫替代,

[0275] 表示任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₃-卤代烷基、C₁-C₃-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷基硫基或C₁-C₄-烷基磺酰基单至三取代的苯基,

[0276] 表示任选被氟、氯、溴、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₃-卤代烷基或C₁-C₃-卤代烷氧基单至二取代的苯基-C₁-C₄-烷基,

[0277] 表示各自任选被氟、氯、溴或C₁-C₄-烷基单至二取代的吡唑基、噻唑基、吡啶基、嘧啶基、呋喃基或噻吩基,

[0278] 表示任选被氟、氯、溴或C₁-C₄-烷基取代的苯氧基-C₁-C₅-烷基或者

[0279] 表示各自任选被氟、氯、溴、氨基或C₁-C₄-烷基单至二取代的吡啶基氧基-C₁-C₅-烷基、嘧啶基氧基-C₁-C₅-烷基或噻唑基氧基-C₁-C₅-烷基,

[0280] R²特别优选表示各自任选被氟或氯单至三取代的C₁-C₁₆-烷基、C₂-C₁₆-烯基、C₁-C₆-烷氧基-C₂-C₆-烷基或多-C₁-C₆-烷氧基-C₂-C₆-烷基,

[0281] 表示任选被氟、氯、C₁-C₄-烷基或C₁-C₄-烷氧基单至二取代的C₃-C₇-环烷基或者

[0282] 表示各自任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₃-烷氧基、C₁-C₃-卤代烷基或C₁-C₃-卤代烷氧基单至三取代的苯基或苄基。

[0283] 在这些作为特别优选提及的残基定义中卤素表示氟、氯和溴,尤其是氟和氯。

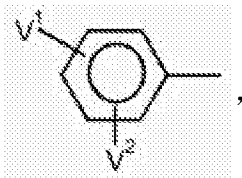
[0284] W非常特别优选表示氢、氯、溴、甲基、乙基、丙基、乙烯基、乙炔基、丙炔基、环丙基、

甲氧基、乙氧基或三氟甲基,

[0285] X非常特别优选表示氯、溴、甲基、乙基、丙基、异丙基、乙烯基、乙炔基、丙炔基、环丙基、甲氧基、乙氧基、三氟甲基、二氟甲氧基、三氟甲氧基或氰基,

[0286] Y和Z 非常特别优选彼此独立地表示氢、氟、氯、溴、碘、甲基、乙基、乙烯基、乙炔基、丙炔基、环丙基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或苯基残基,

[0287]



[0288] 其中在苯基的情况中,仅允许残基 Y或Z之一表示苯基,

[0289] V¹非常特别优选表示氢、氟或氯,

[0290] V²非常特别优选表示氢、氟、氯、甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基或三氟甲基,

[0291] A非常特别优选表示氢、各自任选被氟单至三取代的C₁-C₄-烷基或C₁-C₂-烷氧基-C₁-C₂-烷基,表示环丙基、环戊基或环己基,

[0292] B非常特别优选表示氢、甲基或乙基,

[0293] 条件是,如果在W、X和Y 各自表示甲基或乙基且Z 表示氢的情况中,W和X必须各自表示甲基或W和X必须各自表示乙基时,A和B仅允许各自表示甲基,

[0294] 或

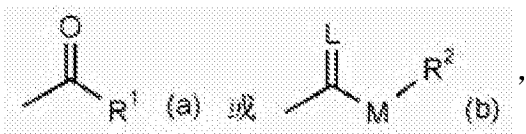
[0295] A、B和它们连接的碳原子非常特别优选表示饱和的 C₅-C₆-环烷基,其中任选一个环成员被氮、氧或硫替代并且其任选被下述基团单或二取代:甲基、乙基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、丙氧基、丁氧基、甲氧基乙氧基、乙氧基乙氧基、烯丙氧基、三氟乙氧基或环丙基甲氧基,其中上述残基(三氟甲基除外)也适合作为N-取代基,或者

[0296] A、B和它们连接的碳原子非常特别优选表示 C₆-环烷基,其任选被任选被氧原子间断的烷叉二基或被包含两个不直接相邻的氧原子的烷撑二氧基取代,由此形成另一个五-或六元环(其任选可被甲基单或二取代),

[0297] A、B和与它们连接的碳原子非常特别优选表示C₅-C₆-环烷基或者C₅-C₆-环烯基,其中两个取代基与和它们连接的碳原子一起表示C₂-C₄-烷二基、C₂-C₄-烯二基或丁二烯二基,

[0298] G非常特别优选表示下述基团之一

[0299]



[0300] 其中

[0301] L表示氧或硫,

[0302] M表示氧或硫,

[0303] R¹非常特别优选表示各自任选被氟或氯单至三取代的C₁-C₁₀-烷基、C₂-C₁₀-烯基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₂-烷基、C₁-C₄-烷基硫基-C₁-C₂-烷基或表示任选被氟、氯、甲基、乙基或甲氧基单取代的C₃-C₆-环烷基,

[0304] 表示任选被下述基团单至二取代的苯基：氟、氯、溴、氰基、硝基、甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、三氟甲基或三氟甲氧基，

[0305] 表示各自任选被氯、溴或甲基单取代的呋喃基、噻吩基或吡啶基，

[0306] R^2 非常特别优选表示各自任选被氟或氯单至三取代的 C_1 - C_{10} -烷基、 C_2 - C_{10} -烯基或 C_1 - C_4 -烷氧基- C_2 - C_4 -烷基，

[0307] 表示环戊基或环己基

[0308] 或者表示各自任选被下述基团单至二取代的苯基或苄基：氟、氯、氰基、硝基、甲基、乙基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基。

[0309] W 特别优选表示甲基、乙基或丙基，

[0310] X 特别优选表示甲基、乙基、氯、溴或甲氧基，

[0311] Y 特别优选表示甲基、氯、碘或溴，

[0312] Z 特别优选表示氢，

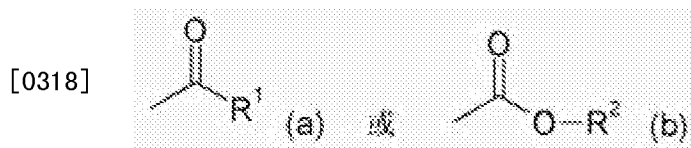
[0313] A 特别优选表示甲基，

[0314] B 特别优选表示甲基，

[0315] 条件是，如果在 W、X 和 Y 各自表示甲基或乙基且 Z 表示氢的情况下，W 和 X 必须各自表示甲基或 W 和 X 必须各自表示乙基时，A 和 B 仅允许各自表示甲基，

[0316] A、B 和与它们连接的碳原子尤其优选表示 C_6 -环烷基，其任选被甲基、甲氧基或甲氧基甲基取代，其中所述取代基可在环的 4-位，

[0317] G 尤其优选表示下述基团之一



[0319] 其中

[0320] R^1 尤其优选表示甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基(强调表示异丙基或叔丁基)，

[0321] R^2 特别优选表示甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基(强调表示乙基)。

[0322] W 同样尤其优选表示氢，

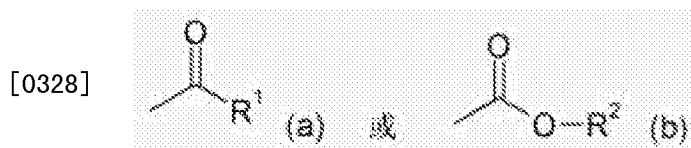
[0323] X 同样尤其优选表示甲基，

[0324] Y 同样尤其优选表示氢，

[0325] Z 同样尤其优选表示甲基，

[0326] A、B 和与它们连接的碳原子同样尤其优选表示 C_6 -环烷基，其任选被甲氧基或甲氧基甲基取代，其中所述取代基既可在环的 3-位又可在 4-位，

[0327] G 同样尤其优选表示下述基团之一



[0329] 其中

[0330] R^1 同样尤其优选表示甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基(特别强调表示 $C(CH_3)_2C_2H_5$)，

[0331] R^2 同样尤其优选表示甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基(强调表示乙基)。

[0332] 上述描述的一般的或在优选范围给出的残基定义和说明可彼此任意组合，即也在各自的范围与优选范围之间任意组合。它们相应地适用于最终产物，并且适用于前体和中间体。

[0333] 根据本发明优选在其中存在上文作为优选(优选)给出的含义的組合的式(I)化合物。

[0334] 根据本发明特别优选在其中存在上文作为特别优选给出的含义的組合的式(I)化合物。

[0335] 根据本发明非常特别优选在其中存在上文作为非常特别优选给出的含义的組合的式(I)化合物。

[0336] 根据本发明尤其优选在其中存在上文作为尤其优选给出的含义的組合的式(I)化合物。

[0337] 强调的是下述的式(I)化合物，在其中 A和B与它们连接于其上的碳原子一起共同表示饱和或不饱和的，含至少一个杂原子的未被取代的或取代的环，或相应的优选的、特别优选的、非常特别优选的和尤其优选的定义。

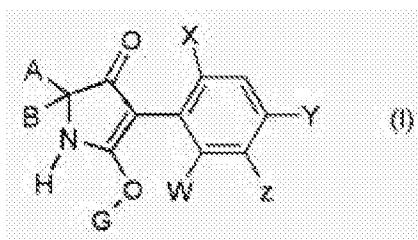
[0338] 饱和或不饱和的烃残基如烷基或烯基，包括与杂原子结合，例如在烷氧基中，只要可能各为直链或支链的。

[0339] 除非另有说明，任选被取代的残基是单或多取代的，其中在多取代的情况下取代基可以相同或不同。

[0340] 除实施例中提及的化合物而外，可具体提及以下的式(I)化合物，其中 $G = COCH_3$ ：

[0341] 表 1

[0342]



[0343]

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

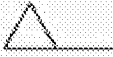
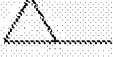
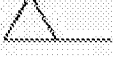
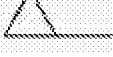
[0344]

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

[0345]

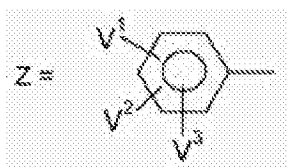
A	B	X	W	Y	Z
CH ₃	CH ₃	Cl	Cl	H	Br
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H
CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H
CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H
CH ₃	CH ₃	Cl	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H
CH ₃	CH ₃	Cl	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	Cl	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	J	H	H	H
CH ₃	CH ₃	J	H	CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	J	CH ₃	H	H
CH ₃	CH ₃	J	C ₂ H ₅	H	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	J
CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	J
CH ₃	CH ₃	J	CH ₃	CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	J	C ₂ H ₅	CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	J	CH ₃	Cl	H
CH ₃	CH ₃	J	C ₂ H ₅	Cl	H
CH ₃	CH ₃	J	Cl	CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	J	H	CH ₃	CH ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	J	H
CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H	J	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	J	H
CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	J	H
CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	J	H
CH ₃	CH ₃	Cl	CH ₃	J	H
CH ₃	CH ₃	Cl	C ₂ H ₅	J	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	J	CH ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	J
CH ₃	CH ₃	J	H	H	CH ₃
CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	H
CH ₃	CH ₃		H	H	H
CH ₃	CH ₃		CH ₃	H	H
CH ₃	CH ₃		H	CH ₃	H
CH ₃	CH ₃		C ₂ H ₅	H	H
CH ₃	CH ₃		CH ₃	CH ₃	H
CH ₃	CH ₃		C ₂ H ₅	CH ₃	H
CH ₃	CH ₃		CH ₃	Cl	H
CH ₃	CH ₃		C ₂ H ₅	Cl	H

[0346]

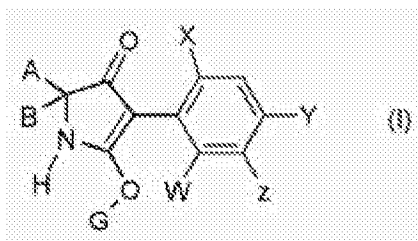
A	B	X	W	Y	Z
CH ₃	CH ₃		Cl	CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		H
CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H		H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃		H
CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃		H
CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅		H
CH ₃	CH ₃	Cl	CH ₃		H
CH ₃	CH ₃	Cl	C ₂ H ₅		H

[0347] 除实施例中提及的化合物而外,此外可具体提及以下的式(I)化合物,其中G = COCH₃和

[0348]



[0349]



[0350] 表 2

[0351]

A	B	W	X	Y	V ¹	V ²	V ³
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	2-F	H	H
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	3-F	H	H
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	4-F	H	H
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	2-F	4-F	H
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	2-F	4-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	2-F	4-CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	2-F	4-OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	3-F	4-F	H
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	3-F	4-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	3-F	4-CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	3-F	4-OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	4-F	3-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	4-F	3-CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	4-F	3-OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	2-F	4-F	5-F
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	2-F	4-F	6-F

[0352]

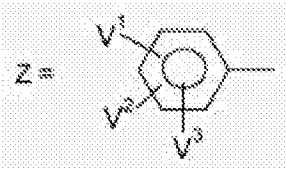
A	B	W	X	Y	V ¹	V ²	V ³
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	2-F	4-Cl	5-F
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	2-F	5-Cl	4-F
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	3-F	4-F	5-F
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	3-Cl	4-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	4-CF ₃	3-F	H
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	4-CN	H	H
CH ₃	CH ₃	H	Cl	H	3-CF ₃	4-F	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	2-F	H	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	3-F	H	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	4-F	H	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	2-F	4-F	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	2-F	4-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	2-F	4-CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	2-F	4-OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	3-F	4-F	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	3-F	4-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	3-F	4-CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	3-F	4-OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	4-F	3-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	4-F	3-CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	4-F	3-OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	2-F	4-F	5-F
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	2-F	4-F	6-F
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	2-F	4-Cl	5-F
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	2-F	5-Cl	4-F
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	3-F	4-F	5-F
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	3-Cl	4-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	4-CF ₃	3-F	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	4-CN	H	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	3-CF ₃	4-F	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	2-F	H	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	3-F	H	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	4-F	H	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	2-F	4-F	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	2-F	4-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	2-F	4-CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	2-F	4-OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	3-F	4-F	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	3-F	4-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	3-F	4-CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	3-F	4-OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	4-F	3-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	4-F	3-CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	4-F	3-OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	2-F	4-F	5-F
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	2-F	4-F	6-F
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	2-F	4-Cl	5-F
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	2-F	5-Cl	4-F
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	3-F	4-F	5-F
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	3-CF ₃	4-F	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	3-Cl	4-Cl	H

[0353]

A	B	W	X	Y	V ¹	V ²	V ³
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	4-CF ₃	3-F	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	4-CN	H	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	2-F	H	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	3-F	H	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	4-F	H	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	2-F	4-F	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	2-F	4-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	2-F	4-CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	2-F	4-OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	3-F	4-F	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	3-F	4-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	3-F	4-CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	3-F	4-OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	4-F	3-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	4-F	3-CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	4-F	3-OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	2-F	4-F	5-F
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	2-F	4-F	6-F
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	2-F	4-Cl	5-F
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	2-F	5-Cl	4-F
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	3-F	4-F	5-F
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	3-Cl	4-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	4-CF ₃	3-F	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	4-CN	H	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	3-CF ₃	4-F	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	2-F	H	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-F	H	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-F	H	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	2-F	4-F	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	2-F	4-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	2-F	4-CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	2-F	4-OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-F	4-F	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-F	4-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-F	4-CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-F	4-OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-F	3-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-F	3-CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-F	3-OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	2-F	4-F	5-F
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	2-F	4-F	6-F
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	2-F	4-Cl	5-F
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	2-F	5-Cl	4-F
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-F	4-F	5-F
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	3-Cl	4-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	4-CF ₃	3-F	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	4-CN	H	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	3-CF ₃	4-F	H

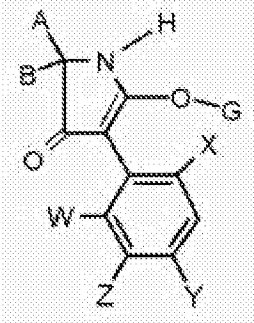
[0354] 作为根据本发明的式(I)化合物的活性物质,其中 G = COCH₃,此外优选合适的是具有表1中提及的 W, X, Y, Z 的残基定义和具有表2中提及的 W, X, Y的残基定义且

[0355]



[0356] 具有表3中提及的 A和B 的残基定义的化合物。

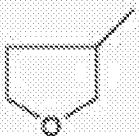
[0357]



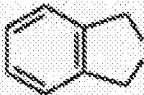
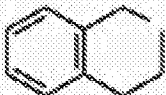
[0358] 表 3

[0359]

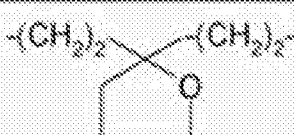
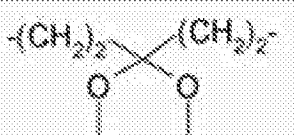
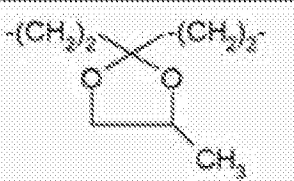
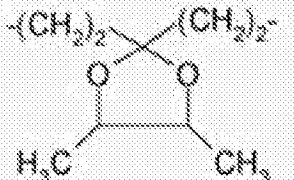
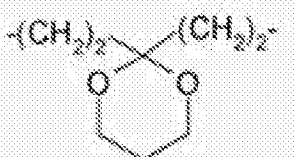
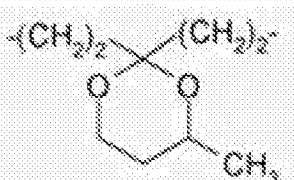
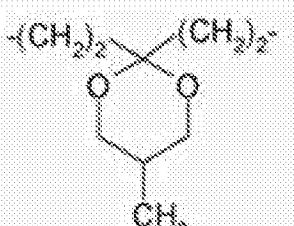
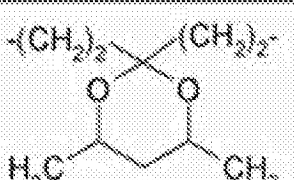
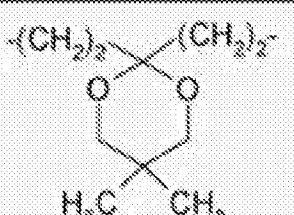
A	B
CH ₃	H
C ₂ H ₅	H
C ₃ H ₇	H
i-C ₃ H ₇	H
C ₄ H ₉	H
i-C ₄ H ₉	H
s-C ₄ H ₉	H
t-C ₄ H ₉	H
CH ₃	CH ₃
C ₂ H ₅	CH ₃
C ₃ H ₇	CH ₃
i-C ₃ H ₇	CH ₃
C ₄ H ₉	CH ₃
i-C ₄ H ₉	CH ₃
s-C ₄ H ₉	CH ₃
t-C ₄ H ₉	CH ₃
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
C ₃ H ₇	C ₃ H ₇

A	B
	CH ₃
	CH ₃
	CH ₃
H ₃ CO-CH ₂ -	CH ₃
H ₃ C-O-CH ₂ -	CH ₃
H ₃ CO-(CH ₂) _n -	CH ₃
H ₃ C-O-(CH ₂) _n -	CH ₃
	CH ₃
	CH ₃
[0360]	
-(CH ₃) ₇ -	
-(CH ₂) ₄ -	
-(CH ₂) ₅ -	
-(CH ₂) ₆ -	
-(CH ₂) ₇ -	
$-(CH_2)_2-N-(CH_2)_2-$ $\quad \quad \quad \overset{ }{O} CH_3$	
$-(CH_2)_2-N-(CH_2)_2-$ $\quad \quad \quad \overset{ }{O} C_2H_5$	
-(CH ₂) ₇ -O-(CH ₂) ₇ -	
-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -	
-(CH ₂) ₇ -S-(CH ₂) ₇ -	
-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₇ -	
-CH ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₇ -	
-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₇ -	
-CH ₂ -CHOC ₃ H ₇ -(CH ₂) ₇ -	
-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₇ -	

[0361]

A	B
$-\text{CH}_2-\text{CHO}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3-(\text{CH}_2)_3-$	
$-\text{CH}_2-\underset{\text{O}-\text{cyclopropyl}}{\text{CH}}-(\text{CH}_2)_2-$	
$-\text{CH}_2-\text{CHOCH}_3-(\text{CH}_2)_3-$	
$-\text{CH}_2-\text{CHOC}_2\text{H}_5-(\text{CH}_2)_3-$	
$-\text{CH}_2-\text{CHOC}_3\text{H}_7-(\text{CH}_2)_3-$	
$-\text{CH}_2-\text{CHOC}_4\text{H}_9-(\text{CH}_2)_3-$	
$-\text{CH}_2-\text{CHO}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3-(\text{CH}_2)_3-$	
$-\text{CH}_2-\underset{\text{O}-\text{cyclopropyl}}{\text{CH}}-(\text{CH}_2)_3-$	
$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHCH}_3-(\text{CH}_2)_2-$	
$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHC}_2\text{H}_5-(\text{CH}_2)_2-$	
$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHC}_3\text{H}_7-(\text{CH}_2)_2-$	
$-(\text{CH}_2)_2-\text{CH}-\text{C}_3\text{H}_7-(\text{CH}_2)_2-$	
$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHOCH}_2-(\text{CH}_2)_2-$	
$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHOC}_2\text{H}_5-(\text{CH}_2)_2-$	
$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHOC}_3\text{H}_7-(\text{CH}_2)_2-$	
$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHO}-\text{CH}_2\text{CF}_3-(\text{CH}_2)_2-$	
$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(\text{CH}_3)_2-(\text{CH}_2)_2-$	
$-\text{CH}_2-(\text{CHCH}_3)_2-(\text{CH}_2)_2-$	
$-\text{CH}_2-\underset{\text{CH}_3}{\text{CH}}-(\text{CH}_2)_2-\text{CH}-$	
$-\text{CH}_2-\underset{\text{CH}_2}{\text{CH}}-\text{CH}-\text{CH}_2-$	
$-\text{CH}_2-\underset{(\text{CH}_2)_4}{\text{CH}}-\text{CH}-(\text{CH}_2)_2-$	
$-\text{CH}_2-\underset{(\text{CH}_2)_3}{\text{CH}}-\text{CH}-(\text{CH}_2)_2-$	
	
	

[0362]

A	B
	
	
	
	
	
	
	
	
	

[0363]

A	B
$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{CH}_2-\text{C}-(\text{CH}_2)_3- \\ \\ \text{CH}_2\text{OCH}_3 \end{array}$	
$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{CH}_2-\text{C}-(\text{CH}_2)_3- \\ \\ (\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3 \end{array}$	
$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -(\text{CH}_2)_2-\text{C}-(\text{CH}_2)_2- \\ \\ \text{CH}_2\text{OCH}_3 \end{array}$	
$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -(\text{CH}_2)_2-\text{C}-(\text{CH}_2)_2- \\ \\ (\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3 \end{array}$	
$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{CH}_2-\text{C}-(\text{CH}_2)_3- \\ \\ \text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	
$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{CH}_2-\text{C}-(\text{CH}_2)_3- \\ \\ (\text{CH}_2)_2\text{OCH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	
$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -(\text{CH}_2)_2-\text{C}-(\text{CH}_2)_2- \\ \\ \text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	
$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -(\text{CH}_2)_2-\text{C}-(\text{CH}_2)_2- \\ \\ (\text{CH}_2)_2\text{OCH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	

[0364] 表4 A、B、V¹、V²、V³、X、W、Y和Z 如在表1、2和3中所述[0365] G =COC₂H₅[0366] 表5 A、B、V¹、V²、V³、X、W、Y和Z 如在表1、2和3中所述[0367] G =COC₃H₇[0368] 表6 A、B、V¹、V²、V³、X、W、Y和Z 如在表1、2和3中所述[0369] G =CO-i-C₃H₇[0370] 表7 A、B、V¹、V²、V³、X、W、Y和Z 如在表1、2和3中所述[0371] G =CO-c-C₃H₅[0372] 表8 A、B、V¹、V²、V³、X、W、Y和Z 如在表1、2和3中所述[0373] G =COC₄H₉[0374] 表9 A、B、V¹、V²、V³、X、W、Y和Z 如在表1、2和3中所述[0375] G =CO-i-C₄H₉[0376] 表10 A、B、V¹、V²、V³、X、W、Y和Z 如在表1、2和3中所述

[0377] $G = CO-t-C_4H_9$

[0378] 表11 A、B、 V^1 、 V^2 、 V^3 、X、W、Y和Z 如在表1、2和3中所述

[0379] $G = CO_2CH_3$

[0380] 表12 A、B、 V^1 、 V^2 、 V^3 、X、W、Y和Z 如在表1、2和3中所述

[0381] $G = CO_2C_2H_5$

[0382] 表13 A、B、 V^1 、 V^2 、 V^3 、X、W、Y和Z 如在表1、2和3中所述

[0383] $G = CO_2C_3H_7$

[0384] 表14 A、B、 V^1 、 V^2 、 V^3 、X、W、Y和Z 如在表1、2和3中所述

[0385] $G = CO_2-i-C_2H_5$

[0386] 表15 A、B、 V^1 、 V^2 、 V^3 、X、W、Y和Z 如在表1、2和3中所述

[0387] $G = CO_2-t-C_4H_9$

[0388] 表16 A、B、 V^1 、 V^2 、 V^3 、X、W、Y和Z 如在表1、2和3中所述

[0389] $G = CO_2C_6H_5$

[0390] 表17 A、B、 V^1 、 V^2 、 V^3 、X、W、Y和Z 如在表1、2和3中所述

[0391] $G = CO_2CH_2C_6H_5$

[0392] 条件是,如果在W、X和Y 各自表示烷基且Z 表示氢的情况下,W和X必须各自表示甲基或W和X必须各自表示乙基时,A和B仅允许各自表示甲基。

[0393] 在文献中已描述过通过添加铵盐可使各种活性物质的活性提高。然而,在此涉及起除垢剂作用的盐(例如WO 95/017817)或具有较长的烷基取代基和/或芳基取代基并且具有渗透作用或提高活性物质的溶解性的盐(例如EP-A 0453086、EP-A 0664081、FR-A2600494、US 4844734、US 5462912、US 5538937、US-A 03/0224939、US-A 05/0009880、US-A05/0096386)。此外,现有技术仅描述了特定活性物质的活性和/或相应药剂的特定应用。在另一些情况下,其涉及磺酸的盐,其中酸本身对昆虫起麻痹作用(US2842476)。通过硫酸铵而实现的活性提高,例如描述了草甘膦(Glyphosate)、草胺膦(Phosphinothricin) 用于除草剂和酮烯醇用于苯基取代的环状化合物 (US 6645914、EP-A20036106、WO 07/068427) 的实例进行了描述。在杀虫剂的情况下,相应的活性提高已被W007/068428描述。

[0394] 也描述了使用硫酸铵作为配制助剂用于某些活性物质和应用(W092/16108),但是其在那里用于稳定制剂,而不是提高活性。

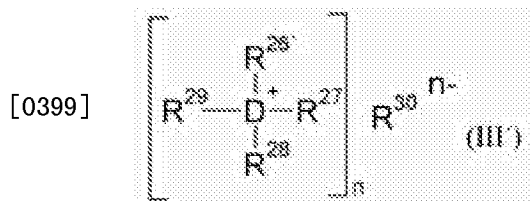
[0395] 现已完全令人惊奇地发现,式(I) 的2-酰氧基吡咯啉-4-酮类化合物类的杀昆虫剂和/或杀螨剂和/或杀线虫剂和/或除草剂的活性可通过向施用溶液添加铵盐或磷盐或通过这些盐引入至包含式(I) 的2-酰氧基吡咯啉-4-酮类化合物的制剂中而明显提高。因此本发明的主题是铵盐或磷盐用于提高植物保护剂的活性的用途,所述植物保护剂包含起杀昆虫和/或杀螨和/或杀线虫和/或除草作用的式(I) 的2-酰氧基吡咯啉-4-酮类化合物作为活性物质。本发明的主题同样是包含起除草和/或杀螨和/或杀昆虫和/或杀线虫作用的式(I)的2-酰氧基吡咯啉-4-酮类化合物和提高活性的铵盐或磷盐的药剂,并且不仅包括配制的活性物质,还包括即用型药剂(喷雾液)。最后,本发明的主题此外是这些药剂用于防治昆虫有害物和/或蛛螨和/或不希望的植物生长的用途。

[0396] 式(I)化合物具有宽的杀昆虫和/或杀螨和/或杀线虫和/或除草活性,但个别地,该活性和/或植物耐受性尚不理想。但是,这些性能可通过添加铵盐或磷盐全部或部分地改

善。

[0397] 所述活性物质可以以宽的浓度范围用于本发明的组合物中。制剂中该活性物质的浓度在此通常为0.1 - 50 重量%。

[0398] 通过式(III') 定义铵盐和磷盐,根据本发明其提高包含式(I)的2-酰氧基吡咯啉-4-酮类化合物类活性物质的植物保护剂的活性



[0400] 其中

[0401] D表示氮或磷,

[0402] D优选表示氮,

[0403] R^{26} 、 R^{27} 、 R^{28} 和 R^{29} 彼此独立地表示氢或各自任选被取代的 C_1 - C_8 -烷基或单不饱和的或多不饱和的,任选被取代的 C_1 - C_8 -亚烷基,其中所述取代基可选自卤素、硝基和氰基,

[0404] R^{26} 、 R^{27} 、 R^{28} 和 R^{29} 优选彼此独立地表示氢或各自任选被取代的 C_1 - C_4 -烷基,其中所述取代基可选自卤素、硝基和氰基,

[0405] R^{26} 、 R^{27} 、 R^{28} 和 R^{29} 特别优选彼此独立地表示氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基,

[0406] R^{26} 、 R^{27} 、 R^{28} 和 R^{29} 非常特别优选表示氢,

[0407] n表示1、2、3或4,

[0408] n优选表示1或2,

[0409] R^{30} 表示无机或有机阴离子,

[0410] R^{30} 优选表示碳酸氢根、四硼酸根、氟离子、溴离子、碘离子、氯离子、磷酸一氢根、磷酸二氢根、硫酸氢根、酒石酸根、硫酸根、硝酸根、硫代硫酸根、硫氰酸根、甲酸根、乳酸根、乙酸酯、丙酸根、丁酸根、戊酸根或草酸根,

[0411] R^{30} 特别优选表示乳酸根、硫酸根、硝酸根、硫代硫酸根、硫氰酸根、草酸根或甲酸根。

[0412] R^{30} 非常特别优选表示硫酸根。

[0413] 式(III') 的铵盐和磷盐可以以宽的浓度范围用于提高包含式(I)的被联苯取代的环酮烯醇的植物保护剂的活性。通常铵盐或磷盐以0.5 至80 毫摩尔/L、优选0.75 至37.5 毫摩尔/L、特别优选1.5 至25 毫摩尔/L 的浓度用于即用的植物保护剂中。在配制的产品的情况下,如此选择制剂中铵盐和/或磷盐的浓度,以使其在将该制剂稀释至所需的活性物质浓度之后位于所给出的一般的、优选的或特别优选的范围。制剂中盐的浓度在此通常为1 - 50 重量%。

[0414] 在本发明的一个优选实施方案中,为提高活性,不仅向植物保护剂添加铵盐和/或磷盐、还另外添加渗透促进剂。被认为完全令人惊奇的是,甚至在这些情况下还可观察到甚至更大的活性提高。因此,本发明的主题同样是渗透促进剂以及铵盐和/或磷盐的组合用于包含起杀昆虫和/或杀螨和/或杀线虫和/或除草作用的式(I) 的2-酰氧基吡咯啉-4-酮类

化合物作为活性物质的植物保护剂的提高活性的用途。本发明的主题同样是包含起除草和/或杀螨和/或杀昆虫和/或杀线虫作用的式(I)的2-酰氧基吡咯啉-4-酮类化合物、渗透促进剂和铵盐和/或磷盐的药剂,且特别地不仅包括配制的活性物质,还包括即用型组合物(喷雾液)。此外,本发明的主题最后是这些药剂用于防治有害昆虫和/或蛛螨和/或不希望的植物生长的用途。

[0415] 在本发明的上下文中,作为渗透促进剂合适的为通常用于改进农用化学活性物质渗入植物中的所有那些物质。在本文中,渗透促进剂定义为,它们从水性喷雾液和/或喷雾层渗透进入植物的表皮并从而可提高活性物质在表皮中的物质移动性(迁移性)。文献(Baur 等人,1997,Pesticide Science 51,131-152)中描述的方法可用于确定该性质。

[0416] 作为渗透促进剂合适的例如是链烷醇烷氧基化物。本发明的渗透促进剂为式(IV')的链烷醇烷氧基化物



[0418] 其中

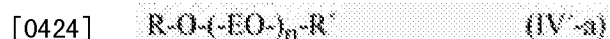
[0419] R 表示具有4-20个碳原子的直链或支链烷基,

[0420] R' 表示氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、正戊基或正己基,

[0421] AO 表示环氧乙烷-残基,环氧丙烷-残基,环氧丁烷-残基或表示环氧乙烷-残基和环氧丙烷-残基或环氧丁烷-残基的混合物,且

[0422] V 表示2 - 30的数。

[0423] 一组优选的渗透促进剂是下式的链烷醇烷氧基化物



[0425] 其中

[0426] R具有上面给出的含义,

[0427] R'具有上面给出的含义,

[0428] EO表示-CH₂-CH₂-O- 和

[0429] n表示2 - 20的数。

[0430] 另一组优选的渗透促进剂是下式的链烷醇烷氧基化物

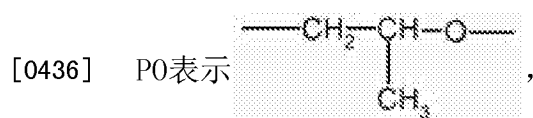


[0432] 其中

[0433] R具有上面给出的含义,

[0434] R'具有上面给出的含义,

[0435] EO表示-CH₂-CH₂-O-,



[0437] p表示1 - 10的数和

[0438] q表示1 - 10的数。

[0439] 另一组优选的渗透促进剂是下式的链烷醇烷氧基化物

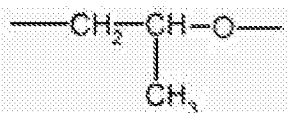
[0440] $R-O-(PO)_r-(EO)_s-R'$ (IV'-c)

[0441] 其中

[0442] R具有上面给出的含义，

[0443] R'具有上面给出的含义，

[0444] EO表示 $-CH_2-CH_2-O-$ ，

[0445] PO表示  ,

[0446] r表示1 - 10的数和

[0447] s表示1 - 10的数。

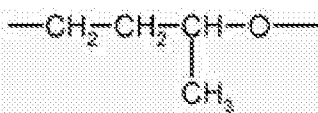
[0448] 另一组优选的渗透促进剂是下式的链烷醇烷氧基化物

[0449] $R-O-(EO)_p-(BO)_q-R'$ (IV'-d)

[0450] 其中

[0451] R和R'具有上面给出的含义，

[0452] EO表示 $-CH_2-CH_2-O-$ ，

[0453] BO表示  ,

[0454] p表示1 - 10的数和

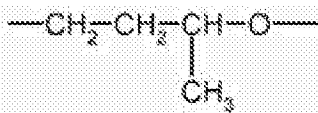
[0455] q表示1 - 10的数。

[0456] 另一组优选的渗透促进剂是下式的链烷醇烷氧基化物

[0457] $R-O-(BO)_r-(EO)_s-R'$ (IV'-e)

[0458] 其中

[0459] R和R'具有上面给出的含义，

[0460] BO表示  ,

[0461] EO表示 $-CH_2-CH_2-O-$ ，

[0462] r表示1 - 10的数和

[0463] s表示1 - 10的数。

[0464] 另一组优选的渗透促进剂是下式的链烷醇烷氧基化物

[0465] $CH_3-(CH_2)_t-CH_2-O-(CH_2-CH_2-O)_u-R'$ (IV'-f)

[0466] 其中

[0467] R'具有上面给出的含义，

[0468] t表示8 - 13的数，

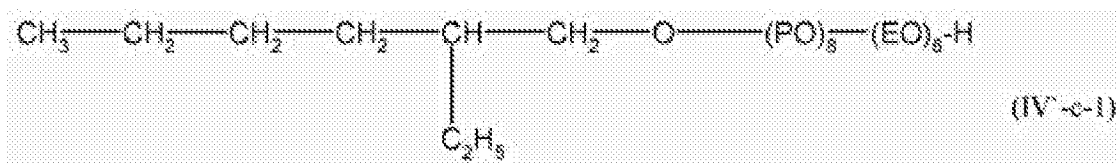
[0469] u表示6 - 17的数。

[0470] 在上述式中，

[0471] R 优选表示丁基、异丁基、正戊基、异戊基、新戊基、正己基、异己基、正辛基、异辛

基、2-乙基己基、壬基、异壬基、癸基、正十二烷基、异十二烷基、月桂基、肉豆蔻基、异十三烷基、三甲基壬基、棕榈基、硬脂基或二十烷基。

[0472] 作为式(IV-c)的链烷醇烷氧基化物的实例可提及下式的2-乙基己基烷氧基化物
[0473]



[0474] 其中

[0475] EO表示 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$,

[0476] PO表示 $\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---O---} \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array}$ 和

[0477] 数8和6 是平均值。

[0478] 作为式(IV-d)的链烷醇烷氧基化物的实例可提及下式

[0479] $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_{10}-\text{O}-(\text{EO})_6-(\text{BO})_2-\text{CH}_3 \quad (\text{IV-d-1})$

[0480] 其中

[0481] EO表示 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$,

[0482] BO表示 $\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH---O---} \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array}$ 和

[0483] 数 10、6和2是平均值。

[0484] 特别优选的式(IV-f)的链烷醇烷氧基化物是这样的式的化合物,其中

[0485] t表示9 - 12的数和

[0486] u表示7 - 9的数。

[0487] 非常特别优选可提及式(IV-f-1)的链烷醇烷氧基化物

[0488] $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_t-\text{CH}_2-\text{O}-(\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O})_u-\text{H} \quad (\text{IV-f-1})$

[0489] 其中

[0490] t表示平均值10.5 和

[0491] u表示平均值8.4。

[0492] 通过上式通用定义所述链烷醇烷氧基化物。这些物质为具有不同链长的所述类型物质的混合物。因此指数计算出也可偏离整数的平均值。

[0493] 所述式的链烷醇烷氧基化物是已知的,并且部分市售可得或可根据已知的方法制备(参见WO 98/35553、WO 00/35278 和EP-A 0681865)。

[0494] 作为渗透促进剂合适的例如也是提升喷雾层中式(I)化合物利用度的物质。这些物质包括,例如,矿物油或植物油。合适的油为所有通常可用于农用化学药剂中的矿物油或植物油,任选改性的。示例性可提及向日葵油、菜籽油、橄榄油、蓖麻油、菜油、玉米籽油、棉花籽油和大豆油,或所述油的酯。优选菜籽油、向日葵油及其甲酯或乙酯。

[0495] 本发明药剂中渗透促进剂的浓度可在宽范围内变化。在配制的植物保护剂的情况

下,其通常为1-95 重量%、优选1 - 55 重量%、特别优选15 - 40 重量%。在即用型药剂(喷雾液)中,该浓度通常为0.1 - 10g/l、优选0.5 - 5g/l。

[0496] 本发明的植物保护剂还可包含其它组分,实例有表面活性剂和/或分散助剂或乳化剂。

[0497] 合适的非离子表面活性剂和/或分散助剂是所有通常可用于农用化学药剂中的这种类型的物质。优选可提及聚环氧乙烷-聚环氧丙烷-嵌段共聚物、直链醇的聚乙二醇醚、脂肪酸与环氧乙烷和/或环氧丙烷的反应产物、以及聚乙烯醇、聚乙烯基吡咯烷酮、聚乙烯醇与聚乙烯基吡咯烷酮的混合聚合物、以及(甲基)丙烯酸和(甲基)丙烯酸酯的共聚物、还有烷基乙氧基化物和烷基芳基乙氧基化物,其可任选被磷酸化并且可任选用碱中和,其中可示例性提及山梨醇乙氧基化物和聚氧亚烷基胺衍生物。

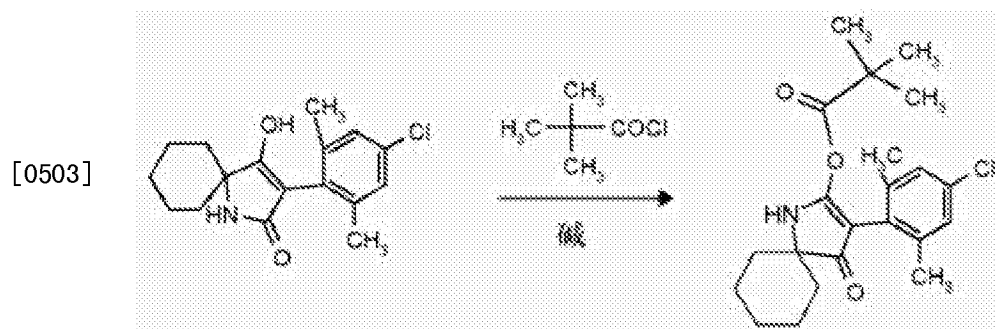
[0498] 合适的阴离子表面活性剂是所有通常可用于农用化学药剂中的这种类型的物质。优选烷基磺酸或烷基芳基磺酸的碱金属盐和碱土金属盐。

[0499] 另一组优选的阴离子表面活性剂和/或分散助剂是在植物油中具有低溶解性的以下盐:聚苯乙烯磺酸的盐,聚乙烯基磺酸的盐,萘磺酸-甲醛-缩合产物的盐,得自萘磺酸、苯酚磺酸与甲醛的缩合产物的盐以及木质素磺酸的盐。

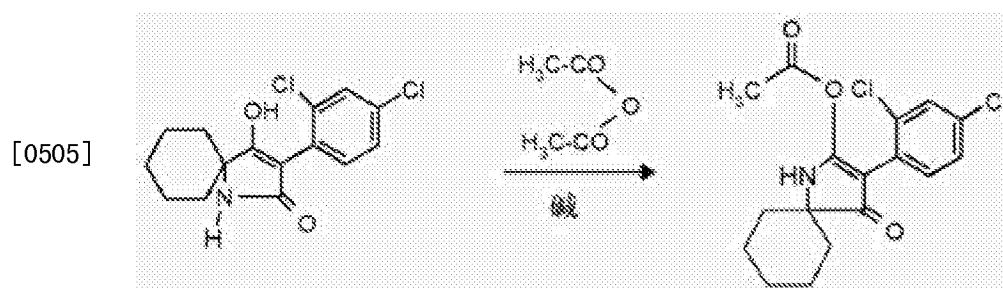
[0500] 可包含在本发明制剂中的合适添加剂为乳化剂、泡沫抑制剂、防腐剂、抗氧化剂、着色剂和惰性填充材料。

[0501] 优选的乳化剂为乙氧基化的壬基酚、烷基酚与环氧乙烷和/或环氧丙烷的反应产物、乙氧基化的芳基烷基酚、以及乙氧基化和丙氧基化的芳基烷基酚、以及硫酸化的或磷酸化的芳基烷基乙氧基化物和/或芳基烷基乙氧基丙氧基化物,其中可示例性提及脱水山梨醇衍生物,如聚环氧乙烷-脱水山梨醇-脂肪酸酯和脱水山梨醇脂肪酸酯。

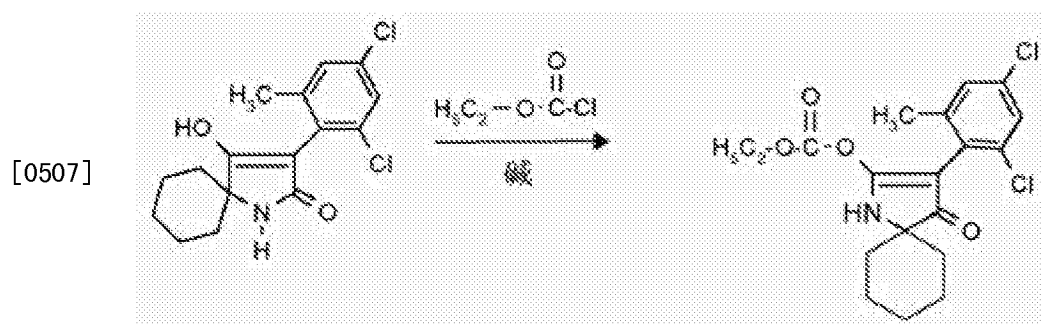
[0502] 根据方法(Aα),如果使用例如 3-[(4-氯-2,6-二甲基)苯基]-1-氮杂螺[4,5]癸烷-2,4-二酮和新戊酰氯作为起始原料,则可通过以下反应路线图说明本发明方法的过程:



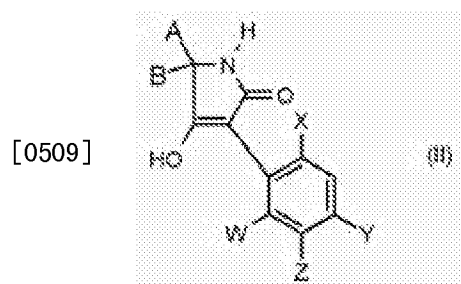
[0504] 根据方法(Aβ),如果使用例如 3-[(2,4-二氯)苯基]-1-氮杂螺-[4,5]-癸烷-2,4-二酮和乙酸酐作为起始原料,则可通过以下反应路线图说明本发明方法的过程:



[0506] 根据方法(B),如果使用例如 3-[(2,4-二氯-6-甲基)苯基]-1-氮杂螺[4,5]癸烷-2,4-二酮和氯甲酸乙酯作为起始原料,则可通过以下反应路线图说明本发明方法的过程:



[0508] 在根据本发明的方法(A)和(B)中作为起始原料需要的式的化合物(II)是由开篇处所引用的专利文献公知的或可根据那里描述的方法类似制备,



[0510] 其中

[0511] A、B、W、X、Y和Z 具有上面给出的含义。

[0512] 为进行根据本发明的方法(A)和(B)作为起始原料需要的式(III)的酰卤、式(IV)的羧酸酐和式(V)的氯甲酸酯或硫代氯甲酸酯是有机化学公知的化合物。

[0513] 方法(A α) 的特征在于,任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下,在每种情况中使式(II)化合物与式(III)的羧酰卤反应。

[0514] 在根据本发明的方法(A α)中作为稀释剂可使用所有对酰卤呈惰性的溶剂。优选可使用烃类,如汽油、苯、甲苯、二甲苯和1,2,3,4-四氢化萘,以及卤代烃,如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、氯苯和邻二氯苯,此外酮,如丙酮和甲基异丙基酮,此外醚,如乙醚、四氢呋喃和二噁烷,此外羧酸酯,如乙酸乙酯,以及强极性溶剂,如二甲基甲酰胺、二甲基亚砷和环丁砜。如果酰卤的水解稳定性允许,该反应也可在水中进行。

[0515] 在根据本发明的方法(A α)的反应中作为酸结合剂可使用所有常用的酸受体。优选使用叔胺,如三乙胺、吡啶、二氮杂双环辛烷(DABCO)、二氮杂双环十一烯(DBU)、二氮杂双环壬烯(DBN)、Hünig-碱和N,N-二甲基苯胺,以及碱土金属氧化物,如氧化镁和氧化钙,此外碱金属碳酸盐和碱土金属碳酸盐,如碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙,和碱金属氢氧化物如氢氧化钠和氢氧化钾。

[0516] 在根据本发明的方法(A α)中反应温度可在较宽的范围内变化。通常在-78°C至 +100°C,优选 -20°C至100°C的温度下进行。

[0517] 在进行本发明方法(A α) 时,通常各自以大约等摩尔的量使用式(II)的起始原料和式(III)的羧酰卤。但是也可以以较大过量来使用羧酰卤(最多5 Mol)。后处理根据常规方法进行。

[0518] 方法(A β) 的特征在于,任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下,在每种情

况中使式(II)化合物与式(IV)的羧酸酐反应。

[0519] 在根据本发明的方法(A_B)中,作为稀释剂优选使用这样的稀释剂,其在使用酰卤的情况下也是优选合适的。此外,过量使用的羧酸酐也可同时充当稀释剂。

[0520] 在方法(A_B)中,作为任选添加的酸结合剂优选使用这样的酸结合剂,其在使用酰卤的情况下也是优选合适的。

[0521] 在根据本发明的方法(A_B)中反应温度可在较宽的范围内变化。通常在-20℃至 +150℃,优选 0℃至100℃的温度下进行。

[0522] 在进行本发明方法(A_B)时,通常各自以大约等摩尔的量使用式(II)的起始原料和式(IV)的羧酰卤。但是也可以以较大过量来使用羧酰卤(最多5 Mo1)。后处理根据常规方法进行。

[0523] 一般而言,稀释剂和过量存在的羧酸酐以及形成的羧酸如此通过蒸馏或通过用有机溶剂或用水洗涤而除去。

[0524] 方法(B)的特征在于,任选在稀释剂存在下和任选在酸结合剂存在下,在每种情况中使式(II)化合物与式(V)的氯甲酸酯或硫代氯甲酸酯反应。

[0525] 在根据本发明的方法(B)的反应中作为酸结合剂可使用所有常用的酸受体。优选使用叔胺,如三乙胺、吡啶、DABCO、DBU、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,此外碱金属碳酸盐和碱土金属碳酸盐,如碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙,和碱金属氢氧化物如氢氧化钠和氢氧化钾。

[0526] 在根据本发明的方法(B)中作为稀释剂可使用所有对氯甲酸酯或硫代氯甲酸酯呈惰性的溶剂。优选可使用烃类,如汽油、苯、甲苯、二甲苯和1,2,3,4-四氢化萘,以及卤代烃,如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、氯苯和邻二氯苯,此外酮,如丙酮和甲基异丙基酮,此外醚,如乙醚、四氢呋喃和二噁烷,此外羧酸酯,如乙酸乙酯,此外腈如乙腈以及强极性溶剂,如二甲基甲酰胺、二甲基亚砷和环丁砷。

[0527] 在根据本发明的方法(B)中反应温度可在较宽的范围内变化。该反应温度通常在-78℃至 +100℃,优选 -20℃至50℃。

[0528] 根据本发明的方法(B)通常在常压下进行。

[0529] 在进行本发明方法(B)时,通常各自以大约等摩尔的量使用式(II)的起始原料和相应的式(V)的氯甲酸酯或硫代氯甲酸酯。但是也可以以较大过量来使用其中一种组分(最多2 Mo1)。后处理根据常规方法进行。一般而言,除去沉淀的盐并通过抽吸稀释剂来浓缩残留的反应混合物。

[0530] 根据本发明的活性物质,兼具良好的植物耐受性和有利的温血动物毒性及良好的环境耐受性,适于保护植物及植物器官,适于增加采收产率,提高采收物的品质及适于防治在农业、园艺业、畜牧业、林业、园圃以及休闲设施中、仓库虫害防治及材料的保护中、以及卫生领域中出现的动物害虫,特别是昆虫、蜘蛛纲动物、蠕虫、线虫及软体动物。它们可优选用作植物保护剂。它们对正常敏感的及具有抗性的物种具有活性,并且对所有的或个别发育阶段具有活性。上述有害生物包括:

[0531] 虱目(Anoplura(Phthiraptera)),例如,畜虱属(*Damalinea* spp.)、血虱属(*Haematopinus* spp.)、毛虱属(*Linognathus* spp.)、虱属(*Pediculus* spp.)、嚼虱属(*Trichodectes* spp.)。

[0532] 蛛形纲(Arachnida),例如,粗脚粉螨属(*Acarus* spp.)、柑橘瘤瘿螨(*Aceria sheldoni*)、刺皮节痹属(*Aculops* spp.)、刺瘿螨属(*Aculus* spp.)、花痹属(*Amblyomma* spp.)、锐缘痹属(*Argas* spp.)、牛痹属(*Boophilus* spp.)、短须螨属(*Brevipalpus* spp.)、苜蓿苔螨(*Bryobia praetiosa*)、皮螨属(*Chorioptes* spp.)、鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*)、始叶螨属(*Eotetranychus* spp.)、梨上瘿螨(*Epitrimerus pyri*)、真叶螨属(*Eutetranychus* spp.)、瘿螨属(*Eriophyes* spp.)、红足海镰螯螨(*Halotydeus destructor*)、半跗线螨属(*Hemitarsonemus* spp.)、璃眼痹属(*Hyalomma* spp.)、硬痹属(*Ixodes* spp.)、黑寡妇蜘蛛(*Latrodectus mactans*)、*Metatetranychus* spp.、*Nuphessa* spp.、小爪螨属(*Oligonychus* spp.)、钝缘痹属(*Ornithodoros* spp.)、全爪螨属(*Panonychus* spp.)、桔芸锈螨(*Phyllocoptruta oleivora*)、侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonemus latus*)、痒螨属(*Psoroptes* spp.)、扇头痹属(*Rhipicephalus* spp.)、根螨属(*Rhizoglyphus* spp.)、疥螨属(*Sarcoptes* spp.)、中东金蝎(*Scorpio maurus*)、狭跗线螨种(*Stenotarsonemus* spp.)、跗线螨属(*Tarsonemus* spp.)、叶螨属(*Tetranychus* spp.)、*Vasates lycopersici*。

[0533] 双壳软体动物纲(Bivalva),例如,饰贝属(*Dreissena* spp.)。

[0534] 唇足目(Chilopoda),例如,地蜈蚣属(*Geophilus* spp.)、蚰蜒属(*Scutigera* spp.)。

[0535] 鞘翅目(Coleoptera),例如,*Acalymma vittatum*、菜豆象(*Acanthoscelides obtectus*)、喙丽金龟属(*Adoretus* spp.)、杨树萤叶甲(*Agelastica alni*)、叩甲属(*Agriotes* spp.)、马铃薯鳃角金龟(*Amphimallon solstitialis*)、家具窃蠹(*Anobium punctatum*)、星天牛属(*Anoplophora* spp.)、花象属(*Anthonomus* spp.)、圆皮蠹属(*Anthrenus* spp.)、梨象属(*Apion* spp.)、阿鳃金龟属(*Apogonia* spp.)、*Atomaria* spp.、毛皮蠹属(*Attagenus* spp.)、恶条豆象(*Bruchidius obtectus*)、豆象属(*Bruchus* spp.)、龟甲属(*Cassida* spp.)、菜豆萤叶甲(*Cerotoma trifurcata*)、龟象属(*Ceutorhynchus* spp.)、凹胫跳甲属(*Chaetocnema* spp.)、*Cleonus mendicus*、宽胸叩头虫属(*Conoderus* spp.)、根颈象属(*Cosmopolites* spp.)、褐新西兰肋翅鳃角金龟(*Costelytra zealandica*)、叩甲属(*Ctenicera* spp.)、象虫属(*Curculio* spp.)、杨干隐喙象(*Cryptorhynchus lapathi*)、细枝象属(*Cylindrocopturus* spp.)、皮蠹属(*Dermestes* spp.)、叶甲属(*Diabrotica* spp.)、蛀野螟属(*Dichocrocis* spp.)、*Diloboderus* spp.、食植瓢虫属(*Epilachna* spp.)、毛跳甲属(*Epitrix* spp.)、烟草钻孔虫(*Faustinus* spp.)、裸蛛甲(*Gibbium psylloides*)、菜心野螟(*Hellula undalis*)、黑异爪蔗金龟(*Heteronychus arator*)、寡节鳃金龟属(*Heteronyx* spp.)、*Hylamorphia elegans*、北美家天牛(*Hylotrupes bajulus*)、紫苜蓿叶象(*Hypera postica*)、咪小蠹属(*Hypothenemus* spp.)、甘蔗大褐齿爪鳃金龟(*Lachnosterna consanguinea*)、合爪负泥虫属(*Lema* spp.)、马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata*)、银潜蛾属(*Leucoptera* spp.)、稻根象(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、筒喙象属(*Lixus* spp.)、*Luperodes* spp.、粉蠹属(*Lyctus* spp.)、*Megascelis* spp.、梳爪叩头虫属(*Melanotus* spp.)、油菜花露尾甲(*Meligethes aeneus*)、鳃金龟属(*Melolontha* spp.)、*Migdolus* spp.、墨天牛属(*Monochamus* spp.)、*Naupactus xanthographus*、黄蛛甲(*Niptus hololeucus*)、椰蛀犀金龟(*Oryctes rhinoceros*)、锯谷盗

(*Oryzaephilus surinamensis*)、*Oryzaphagus oryzae*、耳喙象属(*Otiorrhynchus* spp.)、小青花金龟(*Oxycetonia jucunda*)、辣根猿叶甲(*Phaedon cochleariae*)、食叶鳃金龟属(*Phyllophaga* spp.)、菜跳甲属(*Phyllotreta* spp.)、日本弧丽金龟(*Popillia japonica*)、象甲属(*Premnotrypes* spp.)、跳甲属(*Psylliodes* spp.)、蛛甲属(*Ptinus* spp.)、暗色瓢虫(*Rhizobius ventralis*)、谷蠹(*Rhizopertha dominica*)、谷象属(*Sitophilus* spp.)、尖隐喙象属(*Sphenophorus* spp.)、茎干象属(*Sternechus* spp.)、*Symphyletes* spp.、纤毛象属(*Tanymecus* spp.)、黄粉虫(*Tenebrio molitor*)、拟谷盗属(*Tribolium* spp.)、斑皮蠹属(*Trogoderma* spp.)、籽象属(*Tychius* spp.)、脊虎天牛属(*Xylotrechus* spp.)、距步甲属(*Zabrus* spp.)。

[0536] 弹尾目(*Collembola*)，例如，武装棘跳虫(*Onychiurus armatus*)。

[0537] 倍足目(*Diplopoda*)，例如，千足虫(*Blaniulus guttulatus*)。

[0538] 双翅目(*Diptera*)，例如，伊蚊属(*Aedes* spp.)、潜蝇属(*Agromyza* spp.)、按实蝇属(*Anastrepha* spp.)、按蚊属(*Anopheles* spp.)、瘿蚊属(*Asphondylia* spp.)、果实蝇属(*Bactrocera* spp.)、花园毛蚊(*Bibio hortulanus*)、红头丽蝇(*Calliphora erythrocephala*)、地中海蜡实蝇(*Ceratitis capitata*)、摇蚊属(*Chironomus* spp.)、金蝇属(*Chrysomyia* spp.)、锥蝇属(*Cochliomyia* spp.)、康瘿蚊属(*Contarinia* spp.)、人皮蝇(*Cordylobia anthropophaga*)、库蚊属(*Culex* spp.)、黄蝇属(*Cuterebra* spp.)、橄榄大实蝇(*Dacus oleae*)、叶瘿蚊属(*Dasyneura* spp.)、地种蝇属(*Delia* spp.)、人肤蝇(*Dermatobia hominis*)、果蝇属(*Drosophila* spp.)、稻象属(*Echinocnemus* spp.)、厕蝇属(*Fannia* spp.)、胃蝇属(*Gastrophilus* spp.)、毛眼水蝇属(*Hydrellia* spp.)、黑蝇属(*Hylemyia* spp.)、*Hyppobosca* spp.、皮蝇属(*Hypoderma* spp.)、斑潜蝇属(*Liriomyza* spp.)、绿蝇属(*Lucilia* spp.)、家蝇属(*Musca* spp.)、绿蝽属(*Nezara* spp.)、狂蝇属(*Oestrus* spp.)、瑞典麦秆蝇(*Oscinella frit*)、泉蝇属(*Pegomyia* spp.)、草种蝇属(*Phorbia* spp.)、*Prodiplosis* spp.、胡萝卜茎蝇(*Psila rosae*)、绕实蝇属(*Rhagoletis* spp.)、螫蝇属(*Stomoxys* spp.)、虻属(*Tabanus* spp.)、*Tannia* spp.、根斑蝇属(*Tetanops* spp.)、大蚊属(*Tipula* spp.)。

[0539] 腹足纲(*Gastropoda*)，例如，*Arion* spp.、双脐螺属(*Biomphalaria* spp.)、小泡螺属(*Bulinus* spp.)、野蛞蝓属(*Deroceras* spp.)、土蜗属(*Galba* spp.)、椎实螺属(*Lymnaea* spp.)、钉螺属(*Oncomelania* spp.)、*Pomacea* spp.、琥珀螺属(*Succinea* spp.)。

[0540] 蠕虫纲(*Helminthen*)，例如，十二指肠钩口线虫(*Ancylostoma duodenale*)、斯里兰卡钩口线虫(*Ancylostoma ceylanicum*)、巴西钩口线虫(*Ancylostoma braziliensis*)、钩口线虫属(*Ancylostoma* spp.)、似引蛔线虫(*Ascaris lubricoides*)、蛔虫属(*Ascaris* spp.)、马来布鲁线虫(*Brugia malayi*)、帝汶布鲁线虫(*Brugia timori*)、仰口线虫属(*Bunostomum* spp.)、夏柏特线虫属(*Chabertia* spp.)、枝睾吸虫属(*Clonorchis* spp.)、古柏线虫属(*Cooperia* spp.)、双腔吸虫属(*Dicrocoelium* spp.)、丝状网尾线虫(*Dictyocaulus filaria*)、阔节裂头绦虫(*Diphyllobothrium latum*)、麦地那龙线虫(*Dracunculus medinensis*)、细粒棘球绦虫(*Echinococcus granulosus*)、多房棘球绦虫(*Echinococcus multilocularis*)、蠕形住肠绦虫(*Enterobius vermicularis*)、*Faciola* spp.、血毛线虫属(*Haemonchus* spp.)、异刺线虫属(*Heterakis* spp.)、矮小啮壳绦虫

(*Hymenolepis nana*)、猪圆线虫属(*Hyostrogylus* spp.)、罗阿罗阿线虫(*Loa loa*)、细颈线虫属(*Nematodirus* spp.)、结节线虫属(*Oesophagostomum* spp.)、后睾吸虫属(*Opisthorchis* spp.)、旋盘尾丝虫(*Onchocerca volvulus*)、奥斯脱线虫属(*Ostertagia* spp.)、并殖吸虫属(*Paragonimus* spp.)、*Schistosomen* spp.、富氏类圆线虫(*Strongyloides fuelleborni*)、粪类圆线虫(*Strongyloides stercoralis*)、粪圆线虫属(*Strongyloides* spp.)、牛带绦虫(*Taenia saginata*)、猪带绦虫(*Taenia solium*)、旋毛形线虫(*Trichinella spiralis*)、本地毛形线虫(*Trichinella nativa*)、株布氏旋毛虫(*Trichinella britovi*)、南方旋毛虫(*Trichinella nelsoni*)、*Trichinella pseudospiralis*、毛圆线虫属(*Trichostrongylus* spp.)、毛首鞭形线虫(*Trichuris trichuria*)、班氏吴策线虫(*Wuchereria bancrofti*)。

[0541] 还可以防治原生动物,例如艾美虫(*Eimeria*)。

[0542] 异翅目(*Heteroptera*),例如,南瓜缘蝽(*Anasa tristis*)、拟丽蝽属(*Antestiopsis* spp.)、土长蝽属(*Blissus* spp.)、俊盲蝽属(*Calocoris* spp.)、*Campylomma livida*、异背长蝽属(*Cavelerius* spp.)、臭虫属(*Cimex* spp.)、白瓣麦寄蝇属(*Collaria* spp.)、*Creontiades dilutus*、胡椒缘蝽(*Dasynus piperis*)、*Dichelops furcatus*、厚氏长棒网蝽(*Diconocoris hewetti*)、棉红蝽属(*Dysdercus* spp.)、美洲蝽属(*Euschistus* spp.)、扁盾蝽属(*Eurygaster* spp.)、*Heliopectis* spp.、*Horcias nobilellus*、稻缘蝽属(*Leptocoris* spp.)、叶喙缘蝽(*Leptoglossus phyllopus*)、草盲蝽属(*Lygus* spp.)、蔗黑长蝽(*Macropes excavatus*)、盲蝽科(*Miridae*)、黑摩盲蝽(*Monalonion atratum*)、绿蝽属(*Nezara* spp.)、*Oebalus* spp.、*Pentomidae*、方背皮蝽(*Piesma quadrata*)、壁蝽属(*Piezodorus* spp.)、棉伪斑腿盲蝽(*Psallus seriatus*)、杂盲蝽属(*Psallus* spp.)、*Pseudacysta perseae*、红猎蝽属(*Rhodnius* spp.)、可可褐盲蝽(*Sahlbergella singularis*)、*Scaptocoris castanea*、黑蝽属(*Scotinophora* spp.)、梨冠网蝽(*Stephanitis nashi*)、*Tibraca* spp.、锥猎蝽属(*Triatoma* spp.)。

[0543] 同翅目(*Homoptera*),例如,无网长管蚜属(*Acyrtosipon* spp.)、*Acrogonia* spp.、*Aeneolamia* spp.、隆脉木虱属(*Agonosцена* spp.)、*Aleurodes* spp.、蔗粉虱属(*Aleurolobus barodensis*)、*Aleurothrixus* spp.、杧果叶蝉属(*Amrasca* spp.)、*Anuraphis cardui*、肾圆盾蚧属(*Aonidiella* spp.)、苏联黄粉蚜(*Aphanostigma piri*)、蚜属(*Aphis* spp.)、葡萄叶蝉(*Arboridia apicalis*)、小圆盾蚧属(*Aspidiella* spp.)、圆盾蚧属(*Aspidiotus* spp.)、*Atanus* spp.、茄沟无网蚜(*Aulacorthum solani*)、粉虱属(*Bemisia* spp.)、李短尾蚜(*Brachycaudus helichrysi*)、*Brachycolus* spp.、甘蓝蚜(*Brevicoryne brassicae*)、小褐稻虱(*Calligypona marginata*)、丽黄头大叶蝉(*Carneiocephala fulgida*)、甘蔗粉角蚜(*Ceratovacuna lanigera*)、沫蝉科(*Cercopidae*)、蜡蚧属(*Ceroplastes* spp.)、草莓钉蚜(*Chaetosiphon fragaefolii*)、蔗黄雪盾蚧(*Chionaspis tegalensis*)、茶绿叶蝉(*Chlorita onukii*)、核桃黑斑蚜(*Chromaphis juglandicola*)、黑褐圆盾蚧(*Chrysomphalus ficus*)、玉米叶蝉(*Cicadulina mbila*)、*Coccomytilus halli*、软蚧属(*Coccus* spp.)、茶蔗隐瘤蚜(*Cryptomyzus ribis*)、*Dalbulus* spp.、*Dialeurodes* spp.、*Diaphorina* spp.、白背盾蚧属(*Diaspis* spp.)、履绵蚧属(*Drosicha* spp.)、西圆尾蚜属(*Dysaphis* spp.)、灰粉蚧属(*Dysmicoccus* spp.)、小绿叶蝉属(*Empoasca* spp.)、绵蚜

属(*Eriosoma* spp.)、*Erythroneura* spp.、*Euscelis bilobatus*、拂粉蚧属(*Ferrisia* spp.)、咖啡地粉蚧(*Geococcus coffeae*)、蔗蝗属(*Hieroglyphus* spp.)、假桃病毒叶蝉(*Homalodisca coagulata*)、梅大尾蚜(*Hyalopterus arundinis*)、吹绵蚧属(*Icerya* spp.)、片角叶蝉属(*Idiocerus* spp.)、扁喙叶蝉属(*Idioscopus* spp.)、灰飞虱(*Laodelphax striatellus*)、*Lecanium* spp.、蛎盾蚧属(*Lepidosaphes* spp.)、萝卜蚜(*Lipaphis erysimi*)、长管蚜属(*Macrosiphum* spp.)、*Mahanarva* spp.、高粱蚜(*Melanaphis sacchari*)、*Metcalfiella* spp.、麦无网蚜(*Metopolophium dirhodum*)、黑缘平翅斑蚜(*Monellia costalis*)、*Monelliopsis pecanis*、瘤蚜属(*Myzus* spp.)、莴苣柄长管蚜(*Nasonovia ribisnigri*)、黑尾叶蝉属(*Nephotettix* spp.)、褐飞虱(*Nilaparvata lugens*)、*Oncometopia* spp.、*Orthezia praelonga*、杨梅缘粉虱(*Parabemisia myricae*)、*Paratrioza* spp.、片盾蚧属(*Parlatoria* spp.)、瘿绵蚜属(*Pemphigus* spp.)、玉米蜡蝉(*Peregrinus maidis*)、绵粉蚧属(*Phenacoccus* spp.)、杨平翅绵蚜(*Phloeomyzus passerinii*)、忽布疣蚜(*Phorodon humuli*)、葡萄根瘤蚜属(*Phylloxera* spp.)、苏铁褐点并盾蚧(*Pinnaspis aspidistrae*)、臀纹粉蚧属(*Planococcus* spp.)、梨形原绵蚧(*Protopulvinaria pyriformis*)、桑白盾蚧(*Pseudaulacaspis pentagona*)、粉蚧属(*Pseudococcus* spp.)、木虱属(*Psylla* spp.)、金小蜂属(*Pteromalus* spp.)、*Pyrilla* spp.、笠圆盾蚧属(*Quadraspidiotus* spp.)、*Quesada gigas*、平刺粉蚧属(*Rastrococcus* spp.)、缢管蚜属(*Rhopalosiphum* spp.)、黑盔蚧属(*Saissetia* spp.)、*Scaphoides titanus*、麦二叉蚜(*Schizaphis graminum*)、苏铁刺圆盾蚧(*Selenaspidus articulatus*)、长唇基飞虱属(*Sogatata* spp.)、白背飞虱(*Sogatella furcifera*)、*Sogatodes* spp.、*Stictocephala festina*、*Tenalaphara malayensis*、*Tinocallis caryaefoliae*、广胸沫蝉属(*Tomaspis* spp.)、声蚜属(*Toxoptera* spp.)、粉虱属(*Trialeturodes* spp.)、个木虱属(*Trioxa* spp.)、小叶蝉属(*Typhlocyba* spp.)、尖盾蚧属(*Unaspis* spp.)、葡萄根瘤虱(*Viteus vitifolii*)、么叶蝉属(*Zygina* spp.)。

[0544] 膜翅目(Hymenoptera),例如,残青叶蜂属(*Athalia* spp.)、松叶蜂属(*Diprion* spp.)、实叶蜂属(*Hoplocampa* spp.)、毛蚁属(*Lasius* spp.)、小家蚁(*Monomorium pharaonis*)、胡蜂属(*Vespa* spp.)。

[0545] 等足目(Isopoda),例如,鼠妇(*Armadillidium vulgare*)、栉水虱(*Oniscus asellus*)、球鼠妇(*Porcellio scaber*)。

[0546] 等翅目(Isoptera),例如,顶切叶蚁属(*Acromyrmex* spp.)、美切叶蚁属(*Atta* spp.)、堆角白蚁(*Cornitermes cumulans*)、稻麦小白蚁(*Microtermes obesi*)、土白蚁属(*Odontotermes* spp.)、散白蚁属(*Reticulitermes* spp.)。

[0547] 鳞翅目(Lepidoptera),例如,桑剑纹夜蛾(*Acronicta major*)、褐带卷蛾属(*Adoxophyes* spp.)、烦夜蛾(*Aedia leucomelas*)、地老虎属(*Agrotis* spp.)、*Alabama* spp.、*Amyelois transitella*、条麦蛾属(*Anarsia* spp.)、干煞夜蛾属(*Anticarsia* spp.)、条小卷蛾属(*Argyroplote* spp.)、甘蓝夜蛾(*Barathra brassicae*)、粘弄蝶(*Borbo cinnara*)、棉潜蛾(*Bucculatrix thurberiella*)、松尺蠖(*Bupalus piniarius*)、蛀褐夜蛾属(*Busseola* spp.)、卷叶蛾属(*Cacoecia* spp.)、茶细蛾(*Caloptilia theivora*)、*Capua reticulana*、苹果小卷蛾(*Carpocapsa pomonella*)、桃柱果蛾(*Carposina niponensis*)、冬

尺蛾(*Cheimatobia brumata*)、禾草螟属(*Chilo* spp.)、色卷蛾属(*Choristoneura* spp.)、葡萄果蠹蛾(*Clysia ambiguella*)、*Cnaphalocerus* spp.、云卷蛾属(*Cnephasia* spp.)、*Conopomorpha* spp.、球细颈象属(*Conotrachelus* spp.)、*Copitarsia* spp.、小卷蛾属(*Cydia* spp.)、*Dalaca noctuides*、绢野螟属(*Diaphania* spp.)、小蔗杆草螟(*Diatraea saccharalis*)、金刚钻属(*Earias* spp.)、*Ecdytolopha aurantium*、南美玉米苗斑螟(*Elasmopalpus lignosellus*)、甘薯杆螟(*Eldana saccharina*)、地中海粉斑螟(*Ephestia kuehniella*)、叶小卷蛾属(*Epinotia* spp.)、苹淡褐卷蛾(*Epiphyas postvittana*)、莢斑螟属(*Etiella* spp.)、棕卷蛾属(*Eulia* spp.)、环针单纹蛾(*Eupoecilia ambiguella*)、黄毒蛾属(*Euproctis* spp.)、切根虫属(*Euxoa* spp.)、脏切夜蛾属(*Feltia* spp.)、大蜡螟(*Galleria mellonella*)、细蛾属(*Gracillaria* spp.)、小食心虫属(*Grapholitha* spp.)、*Hedylepta* spp.、棉铃虫属(*Helicoverpa* spp.)、实夜蛾属(*Heliothis* spp.)、褐织蛾(*Hofmannophila pseudospretella*)、同斑螟属(*Homoeosoma* spp.)、长卷蛾属(*Homona* spp.)、苹果巢蛾(*Hyponomeuta padella*)、柿举肢蛾(*Kakivoria flavofasciata*)、贪夜蛾属(*Laphygma* spp.)、梨小食心虫(*Laspeyresia molesta*)、茄白翅野螟(*Leucinodes orbonalis*)、纹潜蛾属(*Leucoptera* spp.)、潜叶细蛾属(*Lithocolletis* spp.)、绿果冬夜蛾(*Lithophane antennata*)、花翅小卷蛾属(*Lobesia* spp.)、豆白隆切根虫(*Loxagrotis albicosta*)、毒蛾属(*Lymantria* spp.)、潜蛾属(*Lyonetia* spp.)、黄褐天幕毛虫(*Malacosoma neustria*)、豆莢野螟(*Maruca testulalis*)、甘蓝夜蛾(*Mamestra brassicae*)、毛胫夜蛾属(*Mocis* spp.)、粘虫(*Mythimna separata*)、水螟属(*Nymphula* spp.)、*Oiketicus* spp.、*Oria* spp.、瘤丛螟属(*Orthaga* spp.)、秆野螟属(*Ostrinia* spp.)、水稻负泥虫(*Oulema oryzae*)、小眼夜蛾(*Panolis flammea*)、稻弄蝶属(*Parnara* spp.)、红铃虫属(*Pectinophora* spp.)、*Perileucoptera* spp.、烟尺蛾属(*Phthorimaea* spp.)、桔潜蛾(*Phyllocnistis citrella*)、小潜细蛾属(*Phyllonorycter* spp.)、菜粉蝶属(*Pieris* spp.)、*Platynota stultana*、金翅夜蛾属(*Plusia* spp.)、菜蛾(*Plutella xylostella*)、小白巢蛾属(*Prays* spp.)、斜纹夜蛾属(*Prodenia* spp.)、*Protoparce* spp.、*Pseudaletia* spp.、大豆夜蛾(*Pseudoplusia includens*)、玉米螟(*Pyrausta nubilalis*)、*Rachiplusia* nu.、禾螟属(*Schoenobius* spp.)、白禾螟属(*Scirpophaga* spp.)、*Scotia segetum*、蛀茎夜蛾属(*Sesamia* spp.)、长须卷蛾属(*Sparganothis* spp.)、灰翅夜蛾属(*Spodoptera* spp.)、举肢蛾属(*Stathmopoda* spp.)、花生麦蛾(*Stomopteryx subsecivella*)、兴透翅蛾属(*Synanthedon* spp.)、*Tecia solanivora*、*Thermesia gemmatalis*、袋谷蛾(*Tinea pellionella*)、幕谷蛾(*Tineola bisselliella*)、卷蛾属(*Tortrix* spp.)、粉夜蛾属(*Trichoplusia* spp.)、*Tuta absoluta*、灰蝶属(*Virachola* spp.)。

[0548] 直翅目(*Orthoptera*)，例如，家蟋(*Acheta domesticus*)、东方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、德国蠊(*Blattella germanica*)、*Dichroplus* spp.、蝼蛄属(*Gryllotalpa* spp.)、马德拉蜚蠊(*Leucophaea maderae*)、飞蝗属(*Locusta* spp.)、黑蝗属(*Melanoplus* spp.)、美洲大蠊(*Periplaneta americana*)、沙漠蝗(*Schistocerca gregaria*)。

[0549] 蚤目(*Siphonaptera*)，例如，角叶蚤属(*Ceratophyllus* spp.)、印鼠客蚤(*Xenopsylla cheopis*)。

[0550] 综合目(Symphyla)目,例如么蚰(*Scutigera* spp.)。

[0551] 缨翅目(Thysanoptera),例如,玉米黄呆蓟马(*Anaphothrips obscurus*)、稻蓟马(*Baliothrips biformis*)、葡萄镰蓟马(*Drepanothrips reuteri*)、*Enneothrips flavens*、花蓟马属(*Frankliniella* spp.)、网蓟马属(*Heliothrips* spp.)、温室条蓟马(*Hercinothrips femoralis*)、葡萄蓟马(*Rhipiphorothrips cruentatus*)、硬蓟马属(*Scirtothrips* spp.)、*Taeniothrips cardamoni*、蓟马属(*Thrips* spp.)。

[0552] 缨尾目(Thysanura),例如衣鱼(*Lepisma saccharina*)。

[0553] 植物寄生线虫类包括例如滑刃线虫属(*Aphelenchoides* spp.)、伞滑刃线虫属(*Bursaphelenchus* spp.)、茎线虫属(*Ditylenchus* spp.)、球异皮线虫属(*Globodera* spp.)、异皮线虫属(*Heterodera* spp.)、长针线虫属(*Longidorus* spp.)、根结线虫属(*Meloidogyne* spp.)、短体线虫属(*Pratylenchus* spp.)、相似穿孔线虫(*Radopholus similis*)、毛刺线虫属(*Trichodorus* spp.)、半穿刺线虫(*Tylenchulus semipenetrans*)、剑线虫属(*Xiphinema* spp.)。

[0554] 所述活性物质可转化为常规制剂,如溶液、乳液、可湿性粉剂、水基-或油基悬浮剂、粉剂、粉末剂(*Stäubemittel*)、膏剂、可溶性粉剂、可溶性颗粒剂、撒播用颗粒剂、悬乳浓缩剂、用活性物质浸渍的天然产物、用活性物质浸渍的合成物质、肥料以及聚合物物质中的微胶囊剂。

[0555] 这些制剂以已知方式来制备,例如通过将所述活性物质与增量剂(*Streckmittel*),即液体溶剂和/或固体载体混合,任选使用表面活性剂,即乳化剂和/或分散剂和/或发泡剂。所述制剂的制备在合适的设备中或在施用前或施用过程中进行。

[0556] 作为助剂可以使用的是适于赋予试剂本身和/或由其得到的制剂(例如喷射液剂、拌种剂)以特定特征,如某些技术性能和/或特殊生物学性能)的那些物质。通常合适的助剂为:增量剂、溶剂及载体。

[0557] 合适的稀释剂为,例如,水、极性及非极性有机化学液剂,所述化学液剂例如选自以下类别:芳香烃及非芳香烃(例如石蜡、烷基苯、烷基萘、氯苯类)、醇及多元醇(其任选也可取代的、醚化的和/或酯化的)、酮(如丙酮、环己酮)、酯(包括脂肪及油)以及(聚)醚、未取代的及取代的胺、酰胺、内酰胺(如N-烷基吡咯烷酮)及内酯、砒以及亚砒(如二甲亚砒)。

[0558] 在使用水作为增量剂的情况中,则也可使用,例如,有机溶剂作为助溶剂。合适的液体溶剂主要为:芳香族化合物如二甲苯、甲苯或烷基萘,氯化的芳香族化合物及氯化的脂族烃如氯苯类、氯乙烯类或二氯甲烷,脂族烃如环己烷或石蜡,例如石油馏分,矿物油及植物油、醇如丁醇或乙二醇及其醚和酯、酮如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮,强极性溶剂如二甲亚砒,以及水。

[0559] 根据本发明,载体是指可为固体或液体的天然的或合成的有机或无机物质,所述活性物质与它们混合或结合后导致更好的适用性,特别是施加在植物或植物部位上。该固体或液体的载体一般是惰性的且应该是可用于农业的。

[0560] 合适的固体载体为:

[0561] 例如铵盐及粉碎的天然矿物例如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、绿坡缕石、蒙脱石或硅藻土,粉碎的合成矿物如细分散的二氧化硅、氧化铝和硅酸盐;适于颗粒剂的固体载体为:例如,粉碎并分级的天然岩石,例如方解石、大理石、浮石、海泡石及白云石,以及合成

的无机及有机粉的颗粒,和得自有机材料如纸张、锯屑、椰壳、玉米棒及烟草茎的颗粒;合适的乳化剂和/或发泡剂为:例如,非离子及阴离子乳化剂,如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚,例如烷基芳基聚乙二醇醚,烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐及蛋白质水解物;合适的分散剂为非离子和/或离子型物质,例如选自以下类别:醇-POE-和/或-POP-醚、酸-和/或POP-POE酯、烷基芳基醚和/或POP-POE醚、脂肪-和/或POP-POE加合物、POE-和/或POP-多元醇衍生物、POE-和/或POP-脱水山梨醇-或-糖加合物、烷基-或芳基-硫酸盐、烷基-或芳基磺酸盐,及烷基-或芳基磷酸盐,或者相应的PO-醚加合物。此外,合适的低聚物或聚合物为,例如由乙烯单体、丙烯酸、EO和/或PO单独地或与例如(多元)醇或(多元)胺结合而得到的低聚物或聚合物。还可使用木质素及其磺酸衍生物、未改性的及改性的纤维素、芳香族和/或脂肪族磺酸及其与甲醛的加合物。

[0562] 在制剂中可使用增粘剂如羧甲基纤维素,粉末、颗粒或胶乳状的天然及合成的聚合物,如阿拉伯树胶、聚乙烯醇、聚乙酸乙烯酯,以及天然磷脂如脑磷脂及卵磷脂及合成的磷脂。

[0563] 可使用着色剂,如无机颜料,例如氧化铁、氧化钛、普鲁士蓝,以及有机着色剂,例如茜素染料、偶氮染料及金属肽菁染料,和痕量营养素,如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐及锌盐。

[0564] 其它的添加剂可为香料、任选改性的矿物油或植物油、蜡及营养素(包括痕量营养素),如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐及锌盐。

[0565] 此外可包含稳定剂,如低温稳定剂、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂或其它改进化学和/或物理稳定性的试剂。

[0566] 所述制剂通常包含0.01-98重量%的活性物质,优选在0.5至90重量%之间。

[0567] 根据本发明的活性物质可以作为其本身或以其也在混合物中的制剂的形式来使用,所述混合物含有一种或更多种合适的杀真菌剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀昆虫剂、杀微生物剂、肥料、引诱剂、杀菌剂、增效剂、安全剂、化学信息素和/或植物生长调节剂,以便由此拓宽活性谱、延长作用持续时间、增加作用速度、避免驱性或预防抗性的形成。另外,这样的活性物质组合可以改善植物生长,增加对高温或低温、对干旱或对水涝或对土壤盐渍度的耐受性,提高开花效率,促进收获和增加产率,加速成熟,提高收获产物的品质和/或营养价值,延长贮存能力和/或提高收获产物的加工性。通过根据本发明的活性物质与混合伴侣的组合获得协同效应,这意味着,各混合物的效力大于基于各个组分的效力可期待的效力。通常可以将所述组合作为拌种剂或在预混合物、罐混物(Tankmix)或成品混合物中使用。

[0568] 可以在宽的范围,优选地以100:1至1:100、特别优选地5:1至1:5的比例,将每一种其它活性物质与根据本发明的活性物质相混合。

[0569] 特别有利的混合伴侣例如下述的:

[0570] 杀昆虫剂/杀螨剂/杀线虫剂:

[0571] 在这里以它们的通用名指出的活性物质是已知的,且描述在例如杀虫剂手册("The Pesticide Manual"第14版,英国作物保护委员会2006)中,或可以在因特网(例如<http://www.alanwood.net/pesticides>)上找到。

[0572] (1) 乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂,例如

[0573] 氨基甲酸酯类,例如棉铃威、涕灭威、噁虫威、丙硫克百威、丁酮威、丁酮砒威、西维因、克百威、丁硫克百威、乙硫苯威、仲丁威、伐虫脒、呋线威、异丙威、灭梭威、灭多威、速灭威、杀线威、抗蚜威、残杀威、硫双威、久效威、唑蚜威、混灭威、XMC和灭杀威;或

[0574] 有机磷酸酯类,例如乙酰甲胺磷、甲基吡啶磷(Azamethiphos)、乙基谷硫磷、甲基谷硫磷、硫线磷、氯氧磷、毒虫畏、氯甲硫磷、毒死蜱、甲基毒死蜱、蝇毒磷、杀螟睛、硫赶式甲基内吸磷、二嗪磷、敌敌畏/DDVP、百治磷、乐果、甲基毒虫畏、乙拌磷、EPN、乙硫磷、丙线磷、伐灭磷、苯线磷、杀螟硫磷、倍硫磷、噻唑磷、庚烯磷、Imicyafos、异柳磷、O-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸异丙酯、异噁唑磷、马拉硫磷、灭蚜磷、甲胺磷、杀扑磷、速灭磷、久效磷、二溴磷、氧乐果、亚砒磷、对硫磷、甲基对硫磷、稻丰散、甲拌磷、伏杀硫磷、亚胺硫磷、磷胺、辛硫磷、甲基嘧啶磷、丙溴磷、胺丙畏、丙硫磷、吡唑硫磷、哒嗪硫磷、啉硫磷、治螟磷、丁基嘧啶磷、双硫磷、特丁磷、杀虫畏、甲基乙拌磷、三唑磷、敌百虫和蚜灭磷。

[0575] (2) GABA控制的氯化物通道拮抗剂,例如

[0576] 环戊二烯-有机氯类,例如氯丹和硫丹;或

[0577] 苯基吡唑类(Fiprole),例如乙虫腈和氟虫腈。

[0578] (3) 钠通道调节剂/电压依赖性的钠通道阻滞剂,例如

[0579] 拟除虫菊酯类,例如氟丙菊酯、烯丙菊酯、右旋顺式反式烯丙菊酯、右旋反式烯丙菊酯、联苯菊酯、生物烯丙菊酯、生物烯丙菊酯S-环戊烯基异构体、生物苄呋菊酯、乙氰菊酯、氟氯氰菊酯、β-氟氯氰菊酯、氯氟氰菊酯、λ-氯氟氰菊酯、γ-氯氟氰菊酯、氯氰菊酯、α-氯氰菊酯、β-氯氰菊酯、θ-氯氰菊酯、ζ-氯氰菊酯、苯醚氰菊酯[(1R)-反式-异构体]、溴氰菊酯、右旋烯炔菊酯[(EZ)-(1R)-异构体]、杀灭阿菊酯、醚菊酯、甲氰菊酯、氰戊菊酯、氟氰戊菊酯、氟氯苯菊酯、氟胺氰菊酯、苄呋醚、炔咪菊酯、噁恩菊酯、氯菊酯、苯醚菊酯[(1R)-反式-异构体]、炔丙菊酯、除虫菊素类(除虫菊)、苄呋菊酯、氟硅菊酯、七氟菊酯、胺菊酯、胺菊酯[(1R)-异构体]、四溴菊酯和四氟苯菊酯;或

[0580] 滴滴涕;或甲氧氯。

[0581] (4) 烟碱型乙酰胆碱受体(nAChR) 激动剂,例如

[0582] 新烟碱类,例如啉虫脒、噻虫胺、呋虫胺、吡虫啉、烯啶虫胺、噻虫啉和噻虫嗪;或

[0583] 烟碱。

[0584] (5) 烟碱型乙酰胆碱受体(nAChR) 别构活化剂,例如

[0585] 斯皮诺素类,例如乙基多杀菌素和多杀菌素。

[0586] (6) 氯化物通道活化剂,例如

[0587] 阿维菌素类/米尔倍霉素类,例如阿维菌素、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐、雷皮菌素和米尔蓓菌素。

[0588] (7) 保幼激素模仿物,例如

[0589] 保幼激素类似物,例如烯虫乙酯、烯虫炔酯和烯虫酯;或

[0590] 苯氧威或吡丙醚。

[0591] (8) 具有未知或非特异性作用机理的活性物质,例如

[0592] 卤代烷类,例如甲基溴和其它卤代烷类;或

[0593] 氯化苦;或硫酰氟;或硼砂;或吐酒石。

[0594] (9) 选择性的拒食剂,例如吡蚜酮;或氟啶虫酰胺。

- [0595] (10) 螨生长抑制剂,例如四螨嗪、噻螨酮和氟螨嗪;或乙螨唑。
- [0596] (11) 昆虫肠膜的微生物干扰剂,例如苏云金芽孢杆菌以色列亚种(*Bacillus thuringiensis subspecies israelensis*)、球形芽孢杆菌纺锤品种(*Bacillus sphaericus*)、苏云金芽孢杆菌鲎泽亚种(*Bacillus thuringiensis subspecies aizawai*)、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(*Bacillus thuringiensis subspecies kurstaki*)、苏云金芽孢杆菌粉虫亚种(*Bacillus thuringiensis subspecies tenebrionis*),和BT植物蛋白:Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab1。
- [0597] (12) 氧化磷酸化抑制剂、ATP干扰剂,例如杀螨隆;或
- [0598] 有机锡化合物,例如三唑锡、三环锡和苯丁锡;或
- [0599] 克螨特;或三氯杀螨砒。
- [0600] (13) 通过中断H⁺质子梯度起作用的氧化磷酸化解联剂,例如虫螨腈、DNOC和氟虫胺。
- [0601] (14) 烟碱型乙酰胆碱受体拮抗剂,例如杀虫磺、杀螟丹-盐酸盐、杀虫环和杀虫双。
- [0602] (15) 0型甲壳质生物合成抑制剂,例如双三氟虫脲、定虫隆、除虫脲、氟环脲、氟虫脲、氟铃脲、虱螨脲、氟酰脲、多氟脲、氟苯脲和杀铃脲。
- [0603] (16) 1型甲壳质生物合成抑制剂,例如噻嗪酮;
- [0604] (17) 双翅目昆虫蜕皮干扰剂,例如灭蝇胺;
- [0605] (18) 蜕皮激素受体激动剂,例如环虫酰肼、氯虫酰肼、甲氧虫酰肼和虫酰肼。
- [0606] (19) 章鱼胺能激动剂,例如双甲脒;
- [0607] (20) 复合物-III电子传递抑制剂,例如氟蚁腓;或灭螨醌;或啞螨酯;
- [0608] (21) 复合物-I电子传递抑制剂,例如METI杀螨剂,例如啞螨醚、啞螨酯、啞螨醚、啞螨灵、吡啶胺和啞虫酰胺;或
- [0609] 鱼藤酮(Derris)。
- [0610] (22) 电压依赖性的钠通道阻滞剂,例如茚虫威;或氰氟虫腓。
- [0611] (23) 乙酰辅酶A羧化酶抑制剂,例如特窗酸和特特拉姆酸(Tetramsäure)衍生物,例如螺螨酯、螺甲螨酯和螺虫乙酯。
- [0612] (24) 复合物-IV电子传递抑制剂,例如膦类,例如磷化铝、磷化钙、膦和磷化锌;或氰化物。
- [0613] (25) 复合物-II电子传递抑制剂,例如腈吡啶酯(Cyenopyrafen)。
- [0614] (28) 兰尼碱受体效应物,例如
- [0615] 二酰胺,例如氯虫酰胺和氟虫双酰胺。
- [0616] 具有未知作用机理的其它活性物质,例如磺胺螨酯(Amidoflumet)、印楝素、异噻虫啉(Benclothiaz)、苯螨特、联苯肼酯、溴螨酯、灭螨猛、冰晶石、氰虫酰胺(Cyazypyr)、丁氟螨酯、三氯杀螨醇、氟螨嗪(Diflovidazin)、氟噻虫砒(Fluensulfone)、啞虫胺(Flufenerim)、丁烯氟虫腈(Flufiprole)、氟吡菌酰胺、呋喃虫酰肼(Fufenozide)、氯噻啉、异菌脲、啞虫丙醚、氟虫吡啶(Pyrifluquinazon)和碘甲烷;以及基于坚硬芽孢杆菌(*Bacillus firmus*)的制剂(I-1582, BioNeem, Votivo)和下述已知的活性化合物:

[0617] 3-溴-N-{2-溴-4-氯-6-[(1-环丙基乙基)氨基甲酰基]苯基}-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-甲酰胺(从W02005/077934获知)、4-[[[(6-溴吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)氨基]呋喃-2(5H)-酮(从W0 2007/115644获知)、4-[[[(6-氟吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)氨基]呋喃-2(5H)-酮(从W0 2007/115644获知)、4-[[[(2-氯-1,3-噻唑-5-基)甲基](2-氟乙基)氨基]呋喃-2(5H)-酮(从W0 2007/115644获知)、4-[[[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)氨基]呋喃-2(5H)-酮(从W0 2007/115644获知)、4-[[[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)氨基]呋喃-2(5H)-酮(从W0 2007/115644获知)、4-[[[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](甲基)氨基]呋喃-2(5H)-酮(从W0 2007/115643获知)、4-[[[(5,6-二氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)氨基]呋喃-2(5H)-酮(从W0 2007/115646获知)、4-[[[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](环丙基)氨基]呋喃-2(5H)-酮(从W0 2007/115643获知)、4-[[[(6-氯吡啶-3-基)甲基](环丙基)氨基]呋喃-2(5H)-酮(从EP-A-0 539 588获知)、4-[[[(6-氯吡啶-3-基)甲基](甲基)氨基]呋喃-2(5H)-酮(从EP-A-0 539 588获知)、[[1-(6-氯吡啶-3-基)乙基](甲基)氧代- λ^4 -硫酮]氰胺(从W0 2007/149134获知)和它的非对映异构体{[(1R)-1-(6-氯吡啶-3-基)乙基](甲基)氧代- λ^4 -硫酮]氰胺(A)和{[(1S)-1-(6-氯吡啶-3-基)乙基](甲基)氧代- λ^4 -硫酮]氰胺(B)}(同样从W0 2007/149134获知)和氟啶虫胺胍(Sulfoxaflo) (同样从W0 2007/149134获知)和它的非对映异构体[(R)-甲基(氧代){[(1R)-1-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]乙基]- λ^4 -硫酮]氰胺(A1)和[(S)-甲基(氧代){[(1S)-1-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]乙基]- λ^4 -硫酮]氰胺(A2)},命名为非对映异构体组A(从W0 2010/074747、W0 2010/074751获知),[(R)-甲基(氧代){[(1S)-1-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]乙基]- λ^4 -硫酮]氰胺(B1)和[(S)-甲基(氧代){[(1R)-1-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]乙基]- λ^4 -硫酮]氰胺(B2)},命名为非对映异构体组B(同样从W0 2010/074747、W0 2010/074751获知)和11-(4-氯-2,6-二甲苯基)-12-羟基-1,4-二氧杂-9-氮杂二螺[4.2.4.2]十四-11-烯-10-酮(从W0 2006/089633获知)、3-(4'-氟-2,4-二甲基联苯-3-基)-4-羟基-8-氧杂-1-氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(从W0 2008/067911获知)、1-{2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亚磺酰基]苯基}-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺(从W0 2006/043635获知)、环丙烷甲酸-[(3S,4aR,12R,12aS,12bS)-3-[(环丙基羰基)氧基]-6,12-二羟基-4,12b-二甲基-11-氧代-9-(吡啶-3-基)-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氢-2H,11H-苯并[f]吡喃并[4,3-b]色烯-4-基]甲酯(从W0 2008/066153获知)、2-氰基-3-(二氟甲氧基)-N,N-二甲基苯磺酰胺(从W02006/056433获知)、2-氰基-3-(二氟甲氧基)-N-甲基苯磺酰胺(从W02006/100288获知)、2-氰基-3-(二氟甲氧基)-N-乙基苯磺酰胺(从W02005/035486获知)、4-(二氟甲氧基)-N-乙基-N-甲基-1,2-苯并噻唑-3-胺-1,1-二氧化物(从W02007/057407获知)、N-[1-(2,3-二甲苯基)-2-(3,5-二甲苯基)乙基]-4,5-二氢-1,3-噻唑-2-胺(从W02008/104503获知)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吡啶-3,4'-哌啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮(从W02003/106457获知)、3-(2,5-二甲苯基)-4-羟基-8-甲氧基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(从W02009/049851获知)、碳酸-3-(2,5-二甲苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基-乙酯(从W02009/049851获知)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基哌啶-1-基)-5-氟嘧啶(从W02004/099160获知)、(2,2,3,3,4,4,5,5-八氟戊基)(3,3,3-三氟丙基)丙二腈(从W02005/063094获知)、(2,2,3,3,4,4,5,5-八氟戊基)(3,3,4,4,4-五氟丁基)丙二腈(从W02005/063094获知)、8-[2-(环丙基甲氧基)-4-(三氟甲基)苯氧基]-3-

[6-(三氟甲基)哒嗪-3-基]-3-氮杂双环[3.2.1]辛烷(从W02007/040280获知)、碳酸-2-乙基-7-甲氧基-3-甲基-6-[(2,2,3,3-四氟-2,3-二氢-1,4-苯并二噁英-6-基)氧基]喹啉-4-基甲酯(从JP2008/110953获知)、乙酸-2-乙基-7-甲氧基-3-甲基-6-[(2,2,3,3-四氟-2,3-二氢-1,4-苯并二噁英-6-基)氧基]喹啉-4-基酯(从JP2008/110953获知)、PF1364 (CAS登记号1204776-60-2) (从JP2010/018586获知)、5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)苄腈(从W02007/075459获知)、5-[5-(2-氯吡啶-4-基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)苄腈(从W02007/075459获知)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-{2-氧代-2-[(2,2,2-三氟乙基)氨基]乙基}苯甲酰胺(从W02005/085216获知)、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](环丙基)氨基}-1,3-噁唑-2(5H)-酮、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)氨基}-1,3-噁唑-2(5H)-酮、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](乙基)氨基}-1,3-噁唑-2(5H)-酮、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](甲基)氨基}-1,3-噁唑-2(5H)-酮(都从W02010/005692获知)、NNI-0711 (从W02002096882获知)、1-乙酰基-N-[4-(1,1,1,3,3,3-六氟-2-甲氧基丙-2-基)-3-异丁基苯基]-N-异丁酰基-3,5-二甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺(从W02002096882获知)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基}氨基)-5-氯-3-甲基苯甲酰基]-2-甲基胍甲酸甲酯(从W02005/085216获知)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基}氨基)-5-氰基-3-甲基苯甲酰基]-2-乙基胍甲酸甲酯(从W02005/085216获知)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基}氨基)-5-氰基-3-甲基苯甲酰基]-2-甲基胍甲酸甲酯(从W02005/085216获知)、2-[3,5-二溴-2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基}氨基)苯甲酰基]-1,2-二乙基胍甲酸甲酯(从W02005/085216获知)、2-[3,5-二溴-2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基}氨基)苯甲酰基]-2-乙基胍甲酸甲酯(从W02005/085216获知)、(5RS,7RS;5RS,7SR)-1-(6-氯-3-吡啶基甲基)-1,2,3,5,6,7-六氢-7-甲基-8-硝基-5-丙氧基咪唑并[1,2-a]吡啶(从W02007/101369获知)、2-{6-[2-(5-氟吡啶-3-基)-1,3-噁唑-5-基]吡啶-2-基}嘧啶(从W02010/006713获知)、2-{6-[2-(吡啶-3-基)-1,3-噁唑-5-基]吡啶-2-基}嘧啶(从W02010/006713获知)、1-(3-氯吡啶-2-基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-(甲基氨基甲酰基)苯基]-3-{[5-(三氟甲基)-1H-四唑-1-基]甲基}-1H-吡唑-5-甲酰胺(从W02010/069502获知)、1-(3-氯吡啶-2-基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-(甲基氨基甲酰基)苯基]-3-{[5-(三氟甲基)-2H-四唑-2-基]甲基}-1H-吡唑-5-甲酰胺(从W02010/069502获知)、N-[2-(叔-丁基氨基甲酰基)-4-氰基-6-甲基苯基]-1-(3-氯吡啶-2-基)-3-{[5-(三氟甲基)-1H-四唑-1-基]甲基}-1H-吡唑-5-甲酰胺(从W02010/069502获知)、N-[2-(叔-丁基氨基甲酰基)-4-氰基-6-甲基苯基]-1-(3-氯吡啶-2-基)-3-{[5-(三氟甲基)-2H-四唑-2-基]甲基}-1H-吡唑-5-甲酰胺(从W02010/069502获知)和(1E)-N-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-N'-氰基-N-(2,2-二氟乙基)乙脒(从W02008/009360获知)。

[0618] 在本发明的一个优选实施方式中,另外将渗透促进剂加入作物保护组合物中以增强作用。作为渗透促进剂也可以考虑,例如,促进式(I)的化合物在喷涂中的可用性的物质。它们包括例如矿物油和植物油。有用的油包括通常可用于农业化学药剂中的所有矿物油或植物油-任选经过改性的。示例性地可列举葵花子油、油菜籽油、橄榄油、蓖麻油、菜籽油、玉米油、棉籽油和大豆油或所述油的酯。优选的是油菜籽油、葵花子油和它们的甲酯或乙酯,

特别是油菜籽油甲酯。

[0619] 在根据本发明的药剂中的渗透促进剂的浓度可以在宽的范围内变化。在配制的作物保护剂中,它通常是1-95重量%、优选地1-55重量%、更优选地15-40重量%。在即用型药剂(喷雾液)中,所述浓度通常是在0.1-10 g/l之间,优选地在0.5-5 g/l之间。

[0620] 在作为杀虫剂使用时,根据本发明的活性物质还可以以其市售制剂和由这些制剂与增效剂混合而制备的使用形式存在。增效剂为通过其提高所述活性物质的活性而所添加的增效剂本身不必具有活性的化合物。

[0621] 当作为杀虫剂使用时,根据本发明的活性物质还可以以其市售制剂和由这些制剂与抑制剂混合而制备的使用形式存在,所述抑制剂能降低活性物质在用于植物周围、植物部分的表面以及植物组织中之后的降解。

[0622] 由市售制剂制得的使用形式的所述活性物质的含量可在宽的范围变化。所述使用形式的活性物质浓度可为0.00000001至95重量%的活性物质,优选地在0.00001至1重量%之间。

[0623] 所述化合物以适于使用形式的常规方式施用。

[0624] 所有植物及植物部分可根据本发明进行处理。在本文中,将植物理解为意指所有植物及植物种群,如希望的及不希望的野生植物或作物植物(包括天然存在的作物植物)。作物植物可为可通过常规植物育种及优选法、或通过生物技术及基因工程法、或这些方法的组合而获得的植物,包括转基因植物和包括受植物育种者权利保护或不受其保护的植物品种。重要的作物植物示例性可提及诸如谷物(小麦、稻)、玉米、大豆、马铃薯、糖用甜菜、番茄、豌豆和其它蔬菜品种、棉花、烟草、油籽油菜以及水果植物(生产苹果、梨、柑橘和葡萄等水果)。植物部分应理解为意指植物在地上及地下的所有部位和器官,如枝、叶、花及根,其中可提及例如叶、针叶、茎、干、花、子实体、果实和种子以及根、块茎及根茎。所述植物部分还包括采收物、以及无性与有性繁殖材料,例如插条、块茎、根茎、分株以及种子。

[0625] 根据本发明用活性物质对植物及植物部分的处理,通过例如浸渍、喷射、蒸发、雾化、散布、涂布、注射等常规处理方法直接进行,或通过作用于其环境、生存空间或贮存空间来进行,且对于繁殖材料,特别是对于种子,还通过施用一层或多层包衣进行。

[0626] 如上所述,可根据本发明对所有植物及其部分进行处理。在一个优选的实施方式中,处理了野生植物种及植物品种、或者通过常规生物培育方法如杂交或原生质体融合而获得的那些植物种及植物品种及其部分。在另一个优选的实施方式中,处理了通过基因工程方法,任选与常规方法相结合而获得的转基因植物和植物品种(遗传修饰的生物体),及其部分。术语“部分”、“植物的部分”及“植物部分”解释如上。

[0627] 特别优选根据本发明处理各自商购的或在使用中的植物品种的植物。植物品种理解为是指这样的植物:其具有新性质(“特性”),且已经通过常规育种、通过诱变或通过重组DNA技术得到。它们可以是栽培种、品种、生物型或基因型。

[0628] 取决于植物种类或植物品种、其位置及其生长条件(土壤、气候、生长期、营养),通过根据本发明的处理还可产生超加性(“协同”)效应。由此,可以实现例如如下超过实际预期的效果:降低根据本发明可使用的物质和药剂的施用量和/或拓宽其活性谱和/或增强其活性、改善植物生长、提高高温或低温耐受性、提高对干旱或者对水含量或土壤盐含量的耐受性、提高开花效率(Blühleistung)、使采收容易、加速成熟、提高采收产率、采收产品的品

质更高和/或营养价值更高、提高采收产品的贮存能力和/或可加工性能。

[0629] 本发明的活性物质不仅对植物-、卫生-及仓库的有害生物起作用,而且对兽医领域中的动物寄生虫(体外及体内寄生虫)起作用,所述动物寄生虫如硬蜱、软蜱、疥螨、叶螨、蝇(叮咬和吸食)、寄生蝇幼虫、虱、毛虱、羽虱及蚤。这些寄生虫包括:

[0630] 虱目(Anoplurida),例如,血虱属、毛虱属、虱属、Phtirus spp.、管虱属(Solenopotes spp.)。

[0631] 食毛目(Mallophagida)及钝角亚目(Unterordnung Amblycerina)与细角亚目(Ischnocerina),例如,毛羽虱属(Trimenopon spp.)、禽虱属(Menopon spp.)、巨羽虱属(Trinoton spp.)、牛羽虱属(Bovicola spp.)、Werneckiella spp.、Lepikentron spp.、畜虱属(Damalina spp.)、嚼虱属、猫羽虱属(Felicola spp.)。

[0632] 双翅目及长角亚目(Unterordnung Nematocerina)与短角亚目(Brachycerina),例如,伊蚊属、按蚊属、库蚊属、蚋属(Simulium spp.)、真蚋属(Eusimulium spp.)、白蛉属(Phlebotomus spp.)、罗蛉属(Lutzomyia spp.)、库蠓属(Culicoides spp.)、斑虻属(Chrysops spp.)、瘤虻属(Hybomitra spp.)、黄虻属(Atylotus spp.)、虻属、麻虻属(Haematopota spp.)、Philipomyia spp.、蜂虱蝇属(Braula spp.)、家蝇属、齿股蝇属(Hydrotaea spp.)、螫蝇属、黑角蝇属(Haematobia spp.)、莫蝇属(Morellia spp.)、厕蝇属、舌蝇属(Glossina spp.)、丽蝇属(Calliphora spp.)、绿蝇属、金蝇属、污蝇属、麻蝇属(Sarcophaga spp.)、狂蝇属、皮蝇属、胃蝇属、虱蝇属(Hippobosca spp.)、羊虱蝇属(Lipoptena spp.)、蜚蝇属(Melophagus spp.)。

[0633] 蚤目(Siphonapterida),例如,蚤属(Pulex spp.)、栉首蚤属(Ctenocephalides spp.(犬栉首蚤(Ctenocephalides canis)、猫栉首蚤(Ctenocephalides felis))、客蚤属(Xenopsylla spp.)、角叶蚤属(Ceratophyllus spp.)。

[0634] 异翅目(Heteropterida),例如,臭虫属、锥猎蝽属(Triatoma spp.)、红猎蝽属(Rhodnius spp.)、锥蝽属(Panstrongylus spp.)。

[0635] 蜚蠊目(Blattarida),例如,东方蜚蠊、美洲大蠊、德国蠊、夏柏拉蟑螂属(Supella spp.)。

[0636] 蜱螨(Acari、Acarina)亚纲及后气门目(Metastigmate)与中气门目(Mesostigmata),例如,锐缘蜱属、钝缘蜱属(Ornithodoros spp.)、残喙蜱属(Otobius spp.)、硬蜱属、花蜱属、牛蜱属、革蜱属(Dermacentor spp.)、Haemophysalis spp.、璃眼蜱属、扇头蜱属、皮刺螨属(Dermanyssus spp.)、刺利螨属(Raillietia spp.)、肺刺螨属(Pneumonyssus spp.)、胸刺螨属(Sternostoma spp.)、蜂螨属(Varroa spp.)。

[0637] 轴螨目(Actinedida)(前气门亚目(prostigmata))及粉螨目(Acaridida)(无气门亚目(Astigmata)),例如,蜂盾螨属(Acarapis spp.)、姬螯螨属(Cheyletiella spp.)、禽螯螨属(Ornithocheyletia spp.)、肉螨属(Myobia spp.)、疮螨属(Psorergates spp.)、蠕形螨属(Demodex spp.)、恙螨属(Trombicula spp.)、Listrophorus spp.、粉螨属(Acarus spp.)、食酪螨属(Tyrophagus spp.)、嗜木螨属(Caloglyphus spp.)、颈下螨属(Hypodectes spp.)、翅螨属(Pterolichus spp.)、痒螨属、皮螨属(Chorioptes spp.)、耳疥螨属(Otodectes spp.)、疥螨属、耳螨属(Notoedres spp.)、疙螨属(Knemidocoptes spp.)、气囊螨属(Cytodites spp.)、鸡雏螨属(Laminosioptes spp.)。

[0638] 根据本发明的式(I)活性物质也适用于防治侵害农业生产家畜的节肢动物,所述农业生产家畜例如牛、绵羊、山羊、马、猪、驴、骆驼、水牛、兔、家鸡、火鸡、鸭、鹅、蜜蜂,其它宠物例如狗、猫、笼鸟及观赏鱼,以及所谓的实验动物,例如仓鼠、豚鼠、大鼠及小鼠。通过对这些节肢动物进行防治,可减少死亡以及(肉、奶、毛、皮、蛋、蜜等)生产力降低的情况,因此通过使用本发明的活性物质可使畜牧业更经济且更简便。

[0639] 根据本发明的活性物质以已知方式通过下述给药形式用于兽医学领域和畜牧业中:通过例如片剂、胶囊剂、饮剂、顿服剂、颗粒剂、膏剂、丸剂、喂服(feed-through)法肠胃给药;通过栓剂;通过例如注射(肌内、皮下、静脉内、腹膜内等)、植入进行肠胃外给药;通过鼻部给药;以例如浸泡或洗浴(药浴)、喷射(喷雾)、浇淋(泼浇和沾湿)、清洗和撒粉的形式进行皮肤给药;以及借助于含活性物质的成型件,例如项圈、耳标、尾标、肢体缚带、笼头、标识器等给药。

[0640] 用于家畜、家禽、宠物等时,式(I)活性物质可作为含有1至80重量%活性物质的制剂(例如粉剂、乳剂、可自由流动药剂)直接使用或稀释100至10000倍后使用,或它们可作为化学浴剂使用。

[0641] 此外,已发现根据本发明的化合物对破坏工业材料的昆虫也具有强的杀虫作用。

[0642] 可示例性并优选地、但非限制性地提及以下昆虫:

[0643] 甲虫,例如,北美家天牛、*Chlorophorus pilosis*、家具窃蠹、报死窃蠹(*Xestobium rufovillosum*)、梳角细脉窃蠹(*Ptilinus pecticornis*)、*Dendrobium pertinex*、松窃蠹(*Ernobius mollis*)、*Priobium carpinii*、褐粉蠹(*Lyctus brunneus*)、非洲粉蠹(*Lyctus africanus*)、南方粉蠹(*Lyctus planicollis*)、栎粉蠹(*Lyctus linearis*)、柔毛粉蠹(*Lyctus pubescens*)、*Trogoxylon aequale*、鳞毛粉蠹(*Minthes rugicollis*)、材小蠹种(*Xyleborus spec.*)、*Tryptodendron spec.*、咖啡黑长蠹(*Apate monachus*)、槲长蠹(*Bostrychus capucins*)、褐异翅长蠹(*Heterobostrychus brunneus*)、棘长蠹种(*Sinoxylon spec.*)、竹长蠹(*Dinoderus minutus*);

[0644] 膜翅目昆虫(*Hautflügler*),例如,大树蜂(*Sirex juvencus*)、枞大树蜂(*Urocerus gigas*)、泰加大树蜂(*Urocetus gigas taignus*)、*Urocetus augur*;

[0645] 白蚁,例如,欧洲木白蚁(*Kaloterms flavicollis*)、麻头堆砂白蚁(*Cryptoterms brevis*)、灰点异白蚁(*Heteroterms indicola*)、欧美散白蚁(*Reticulitermes flavipes*)、桑特散白蚁(*Reticulitermes santonensis*)、南欧网纹白蚁(*Reticulitermes lucifugus*)、达尔文澳白蚁(*Mastoterms darwiniensis*)、内华达古白蚁(*Zootermopsis nevadensis*)、家白蚁(*Coptoterms formosanus*);

[0646] 蠹虫(*Bristletail*),例如衣鱼。

[0647] 在此上下文中,应将工业材料理解为是指非活体材料,例如优选为塑料、粘合剂、胶料、纸张和纸板、皮革、木材、经加工的木材制品及涂料组合物。

[0648] 即用组合物还可任选包含其它杀虫剂,且还可任选包含一种或多种杀真菌剂。

[0649] 关于可能的其它混合参与物,可参考上述杀虫剂和杀真菌剂。

[0650] 本发明的化合物同样可用于保护与盐水或微咸水接触的物体,特别是船体、筛、网、建筑物、码头装置及信号装置,以防止植被覆盖。

[0651] 此外,根据本发明的化合物可单独地或与其它活性物质结合而用作防污剂。

[0652] 所述活性物质还适于防治在家庭-、卫生-及仓库虫害防治中在封闭空间内出现的动物害虫,特别是昆虫、蛛形纲动物及螨类,所述封闭空间例如住所、工厂车间、办公室、驾驶室等。它们可单独地或与其它活性物质和助剂结合用于家用杀虫产品中以防治这些有害生物。它们对于敏感的和具有抗性的物种和对全部发育阶段均有效。这些有害生物包括:

[0653] 蝎目(Scorpionidea),例如,地中海黄蝎(*Buthus occitanus*)。

[0654] 蜱螨目(Acarina),例如,波斯锐缘蜱(*Argas persicus*)、鸽锐缘蜱(*Argas reflexus*)、苔螨亚种(*Bryobia* spp.)、鸡皮刺螨、家嗜甜螨(*Glyciphagus domesticus*)、非洲钝缘蜱(*Ornithodoros moubat*)、血红扇头蜱(*Rhipicephalus sanguineus*)、阿氏真恙螨(*Trombicula alfreddugesi*)、*Neutrombicula autumnalis*、特嗜皮螨(*Dermatophagoides pteronissimus*)、法嗜皮螨(*Dermatophagoides forinae*)。

[0655] 蜘蛛目(Araneae),例如,捕鸟蛛(Aviculariidae)、圆蛛(Araneidae)。

[0656] 盲蛛目(Opiliones),例如,螯蝎(*Pseudoscorpiones chelifer*)、*Pseudoscorpiones cheiridium*、长跣盲蛛(*Opiliones phalangium*)。

[0657] 等足目,例如,栉水虱、球鼠妇(*Porcellio scaber*)。

[0658] 倍足目,例如,*Blaniulus guttulatus*、山蛰虫(*Polydesmus* spp.)。

[0659] 唇足目,例如,地蜈蚣属(*Geophilus* spp.)。

[0660] 衣鱼目(Zygentoma),例如,栉衣鱼属(*Ctenolepisma* spp.)、衣鱼、盗火虫(*Lepismodes inquilinus*)。

[0661] 蜚蠊目(Blattaria),例如,东方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、德国蠊、亚洲蠊(*Blattella asahinai*)、马德拉蜚蠊、角腹蠊属(*Panchlora* spp.)、木蠊属(*Parcoblatta* spp.)、澳洲大蠊(*Periplaneta australasiae*)、美洲大蠊、大褐大蠊(*Periplaneta brunnea*)、烟色大蠊(*Periplaneta fuliginosa*)、棕带蜚蠊(*Supella longipalpa*)。

[0662] 跳跃亚目(Saltatoria),例如,家蟋(*Acheta domesticus*)。

[0663] 革翅目,例如,欧洲球螋。

[0664] 等翅目,例如,木白蚁属(*Kaloterms* spp.)、散白蚁属(*Reticulitermes* spp.)。

[0665] 啮虫目(Psocoptera),例如,*Lepinatus* spp.、粉啮虫属(*Liposcelis* spp.)。

[0666] 鞘翅目,例如,圆皮蠹属(*Anthrenus* spp.)、毛皮蠹属(*Attagenus* spp.)、皮蠹属(*Dermestes* spp.)、长头谷盗(*Latheticus oryzae*)、隐跗郭公虫属(*Necrobia* spp.)、蛛甲属、谷蠹(*Rhizopertha dominica*)、谷象(*Sitophilus granarius*)、米象(*Sitophilus oryzae*)、玉米象(*Sitophilus zeamais*)、药材甲(*Stegobium paniceum*)。

[0667] 双翅目,例如,埃及伊蚊(*Aedes aegypti*)、白纹伊蚊(*Aedes albopictus*)、带喙伊蚊(*Aedes taeniorhynchus*)、按蚊属、红头丽蝇、高额麻虻(*Chrysozona pluvialis*)、五带淡色库蚊(*Culex quinquefasciatus*)、尖音库蚊(*Culex pipiens*)、环喙库蚊(*Culex tarsalis*)、果蝇属、夏厕蝇(*Fannia canicularis*)、家蝇(*Musca domestica*)、白蛉属、*Sarcophaga carnaria*、蚋属、厩螯蝇(*Stomoxys calcitrans*)、欧洲大蚊(*Tipula paludosa*)。

[0668] 鳞翅目,例如,小蜡螟(*Achroia grisella*)、大蜡螟、印度谷螟(*Plodia interpunctella*)、木塞谷蛾(*Tinea cloacella*)、袋谷蛾、幕谷蛾。

[0669] 蚤目,例如,犬栉首蚤(*Ctenocephalides canis*)、猫栉首蚤(*Ctenocephalides*

felis)、人蚤(*Pulex irritans*)、穿皮潜蚤(*Tunga penetrans*)、印鼠客蚤(*Xenopsylla cheopis*)。

[0670] 膜翅目,例如,广布弓背蚁(*Camponotus herculeanus*)、黑臭蚁(*Lasius fuliginosus*)、黑蚁(*Lasius niger*)、*Lasius umbratus*、小家蚁、*Paravespula* spp.、铺道蚁(*Tetramorium caespitum*)。

[0671] 虱目,例如,头虱(*Pediculus humanus capitis*)、体虱(*Pediculus humanus corporis*)、瘿棉蚜属(*Pemphigus* spp.)、*Phylloera vastatrix*、阴虱(*Phthirus pubis*)。

[0672] 异翅目,例如,热带臭虫(*Cimex hemipterus*)、温带臭虫(*Cimex lectularius*)、长红猎蝽(*Rhodinus prolixus*)、侵扰锥猎蝽(*Triatoma infestans*)。

[0673] 在家用杀虫剂领域中的应用可单独进行或与其它适合的活性物质结合进,所述其它适合的活性物质如磷酸酯类、氨基甲酸酯类、拟除虫菊酯类、新烟碱类、生长调节剂或其它已知杀虫剂类活性物质。

[0674] 它们可以以下产品形式使用:气雾剂、无压喷射产品例如泵喷射剂及雾化器喷射剂、自动弥雾系统、雾化剂、泡沫剂、凝胶剂、具有由纤维素或聚合物制成的蒸发片的蒸发产品、液体蒸发剂、凝胶-及薄膜蒸发剂、推进器驱动的蒸发剂、无能量消耗的或无源的蒸发体系、捕蛾纸、捕蛾袋和捕蛾胶,作为颗粒剂或粉末剂使用,在用于散播的饵料或毒饵站中使用。

[0675] 本发明式(I)化合物(活性物质)对宽范围的经济上重要的单子叶和双子叶一年生有害植物具有出色的除草活性。所述活性物质也有效地防治由根茎(*Rhizomen*)、根茎(*Wurzelstöcken*)或其它多年生器官萌发的难以防治的多年生有害植物。

[0676] 所用活性物质施用量可在较宽范围内波动。其基本取决于所需效果的种类。通常,施用量为1g 至10kg 活性物质/ 每公顷土壤面积,优选为5g 至5kg/ 每公顷。

[0677] 在某些浓度比例下,本发明的活性物质组合物的作物植物的耐受性的有利效果特别强烈突出。然而,活性物质组合中活性物质的重量比可在较宽范围变化。通常,1重量份的式(I)活性物质分配0.001 至1000 重量份、优选0.01 至100 重量份、特别优选0.05 至20 重量份的一种上述(b')下所提及的改善作物植物耐受性的化合物(解毒剂/安全剂)。

[0678] 本发明的活性物质组合物通常以成品制剂的形式施用。然而,存在于活性物质结合物中的活性物质也可以单独制剂形式在使用过程中混合,即以储罐混制剂的形式施用。

[0679] 对于某些施用目的,特别是在芽后方法中,其可进一步有利地在制剂中容纳植物耐受的矿物油或植物油(例如市售制剂“Rako Binol”)或铵盐例如硫酸铵或硫氰酸铵作为其它添加剂。

[0680] 所述新的活性物质组合物可以以其本身、以其制剂形式或通过进一步稀释由其制备的使用形式,如即用溶液、悬浮剂、乳液、粉剂、膏剂和颗粒剂来使用。施用采用常规方式,例如通过浇灌、喷雾、雾化、撒粉或撒播。

[0681] 本发明活性物质组合物的施用量可在某一范围内变化;其尤其取决于天气和土壤因素。通常,该施用量可为0.001 至5kg/ 公顷,优选0.005 至2kg/ 公顷,特别优选0.01 至0.5kg/ 公顷。

[0682] 根据其性质,根据本发明使用的安全剂可用于预处理作物植物的种子(拌种)或可在播种之前将其引入至播种沟或在除草剂之前单独使用或在植物发芽之前或之后与除

草剂一起使用。

[0683] 作为植物的实例提及重要的作物植物,如谷类(小麦、大麦、稻)、玉米、大豆、马铃薯、棉花、油菜、甜菜、甘蔗以及果树(具有果实苹果、梨、柑橘类水果和葡萄),其中特别强调谷类、玉米、大豆、马铃薯、棉花和油菜。

[0684] 用根据本发明的活性物质,可以处理所有植物及植物部位。在本说明书中,将植物理解为所有植物和植物种群,如希望的和不希望的野生植物或作物(包括自然生长的作物)。作物可为通过常规育种和优化法或通过生物技术和基因工程方法或通过上述方法的结合可获得的植物,包括转基因植物和包括受品种保护权保护或不受品种保护权保护的植物品种。植物部位应理解为植物的所有地上及地下部分以及植物器官,如茎尖(Spross)、叶、花和根,其中示例性列举叶、针叶、茎、干、花、子实体、果实和种子以及根、块茎和根茎。植物部位还包括收割物和无性及有性繁殖材料,例如插枝(Stecklinge)、块茎、根茎、插条(Ableger)及种子。

[0685] 根据本发明的用活性物质对植物及植物部位进行的处理根据常规方法直接或通过作用于其环境、生境或贮存空间进行,所述常规方法例如通过浸泡、喷洒、蒸发、雾化、撒播、涂抹、注射和在繁殖材料的情况中,特别是在种子的情况中,此外通过一层或多层包衣。

[0686] 因此,本发明的主题也是用于防治不希望的植物或用于调节植物生长(优选用于植物作物中)的方法,其中将一种或多种本发明化合物施用于植物(例如有害植物,如单子叶或双子叶杂草或不希望的作物植物)、种子(例如谷粒、种子或无性繁殖体,如块茎或带芽的枝条部位)或植物生长区域(例如栽培区域)。在本文中,本发明的化合物例如可在播种前-(任选也通过引入土壤中)、芽前-或芽后方法施用。以下将具体示例性提及一些可由本发明化合物防治的单子叶和双子叶杂草植物群,但并非意欲通过该列举限于特定属种。

[0687] 以下属的单子叶有害植物:山羊草属(Aegilops)、冰草属(Agropyron)、剪股颖属(Agrostis)、看麦娘属(Alopecurus)、Apera、燕麦属(Avena)、臂形草属(Brachiaria)、雀麦属(Bromus)、蒺藜草属(Cenchrus)、鸭跖草属(Commelina)、狗牙根属(Cynodon)、莎草属(Cyperus)、龙爪茅属(Dactyloctenium)、马唐属(Digitaria)、稗属(Echinochloa)、荸荠属(Eleocharis)、蟋蟀草属(Eleusine)、画眉草属(Eragrostis)、野黍属(Eriochloa)、羊茅属(Festuca)、飘拂草属(Fimbristylis)、异蕊花属(Heteranthera)、白茅属(Imperata)、鸭嘴草属(Ischaemum)、千金子属(Leptochloa)、黑麦草属(Lolium)、雨久花属(Monochoria)、黍属(Panicum)、雀稗属(Paspalum)、蒹草属(Phalaris)、梯牧草属(Phleum)、早熟禾属(Poa)、筒轴茅属(Rottboellia)、慈姑属(Sagittaria)、莞草属(Scirpus)、狗尾草属(Setaria)、高粱属(Sorghum)。

[0688] 以下属的双子叶杂草:白麻属(Abutilon)、苋属(Amaranthus)、豚草属(Ambrosia)、Anoda、春黄菊属(Anthemis)、Aphanes、蒿属(Artemisia)、滨藜属(Atriplex)、雏菊属(Bellis)、鬼针属(Bidens)、芥属(Capsella)、飞廉属(Carduus)、决明属(Cassia)、矢车菊属(Centaurea)、藜属(Chenopodium)、蓟属(Cirsium)、旋花属(Convolvulus)、曼陀罗属(Datura)、山蚂蝗属(Desmodium)、刺酸模属(Emex)、糖芥属(Erysimum)、大戟属(Euphorbia)、鼬瓣花属(Galeopsis)、牛膝菊属(Galinsoga)、拉拉藤属(Galium)、芙蓉属

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

[0689] 所列植物可根据本发明特别有利地用通式(I) 的化合物或本发明的活性物质混合物来处理。活性物质或混合物中的上述优选范围也适用于这些植物的处理。特别强调用本文中明确提及的化合物或混合物处理植物。

[0690] 如果将本发明的化合物在发芽前施用于土壤表面,则完全阻止了杂草幼苗的发芽,或者杂草生长直至其达到子叶期,但是然后其生长停止并最终在3 周至4 周之后完全死亡。

[0691] 当将所述活性物质在芽后施用于绿色植物部位,则在处理后出现生长停止,并且所述有害植物停留在施用时间点存在的生长阶段,或在一段时间后彻底死亡,从而以此方式非常早且持久地消除对作物植物有害的杂草竞争。

[0692] 尽管本发明的化合物针对单子叶和双子叶杂草表现出显著的除草活性,但取决于本发明各化合物的结构及其施用量,经济上重要作物的作物植物仅受到微小损害或完全不受损害,所述经济上重要的作物例如:以下属的双子叶作物,落花生属(Arachis)、甜菜属(Beta)、芸苔属(Brassica)、黄瓜属(Cucumis)、南瓜属(Cucurbita)、向日葵属(Helianthus)、胡萝卜属(Daucus)、大豆属(Glycine)、棉属(Gossypium)、番薯属(Ipomoea)、莴苣属(Lactuca)、亚麻属(Linum)、番茄属(Lycopersicon)、芒属(Miscanthus)、烟草属(Nicotiana)、菜豆属(Phaseolus)、豌豆属(Pisum)、茄属(Solanum)、蚕豆属(Vicia);或以下属的单子叶作物,葱属(Allium)、凤梨属(Ananas)、天门冬属(Asparagus)、燕麦属(Avena)、大麦属(Hordeum)、稻属(Oryza)、黍属(Panicum)、甘蔗属(Saccharum)、黑麦属(Secale)、高粱属(Sorghum)、小黑麦属(Triticale)、小麦属(Triticum)、玉蜀黍属(Zea)。由于此原因,本发明化合物非常好地适于选择性防治在植物栽培,如农业有益植物或观赏植物中不希望的植物生长。

[0693] 此外,本发明的化合物(取决于其各自的结构及所用的施用量)具有显著的对作物植物的生长调节性能。它们以调节方式参与植物自身代谢并因此可用于以定向的方式影响植物成分以及用于使收获容易,例如通过引起脱水和矮化生长。此外,它们还适合一般地控制和抑制不希望的营养生长,且在此过程中不杀死植物。抑制营养生长在多种单子叶和双子叶作物中起到了重要的作用,因为例如可由此减少或完全避免倒伏。

[0694] 如上面已经提到的,所有的植物和它们的部位均可根据本发明进行处理。在一个优选的实施方案中,对野生的或者通过常规生物育种方法,如杂交或原生质体融合得到的植物种类和植物品种及其部位进行处理。在另一优选的实施方案中,对通过任选地结合常规方法的基因工程方法获得的转基因植物和植物品种(遗传修饰生物)及其部位进行处理。

术语“部位”、“植物的部位”或“植物部位”已在上文解释。

[0695] 特别优选地,根据本发明对各自市售可得或正在使用的植物品种的植物进行处理。植物品种是指通过传统育种、通过诱变或通过重组DNA技术栽培的具有新性质(“特性”)的植物。它们可以是品种、种(Rassen)、生物型或基因型。

[0696] 根据植物种类或植物品种、其位置及其生长条件(土壤、气候、生长期、营养),通过根据本发明的处理还可产生超加性(“协同”)效应。由此,可以实现例如如下超过实际预期的效果:降低根据本发明可使用的物质和药剂的施用量和/或拓宽其活性谱和/或增强其活性、改善植物生长、提高高温或低温耐受性、提高对干旱或者对水含量或土壤盐含量的耐受性、提高开花效率、使采收容易、加速成熟、提高采收产率、采收产品的品质更高和/或营养价值更高、提高采收产品的贮存能力和/或可加工性能。

[0697] 由于其除草和植物生长调节性质,所述活性物质还可用于防治已知的基因修饰植物或仍待开发的基因修饰植物作物中的有害植物。通常,转基因植物的特点是特别有利的特性,例如:对某些农药的抗性,主要是对某些除草剂的抗性;对植物病害或植物病害的致病生物的抗性,例如对某些昆虫、线虫或微生物如真菌、细菌或病毒)的抗性。其它具体的特性涉及例如采收物的量、品质、可贮性、组成和特殊成分。因此,具有提高的淀粉含量或改变的淀粉品质的转基因植物或者其收获物具有不同脂肪酸组成的转基因植物是已知的。其它具体特性可为对非生物胁迫例如热、冷、干旱、盐及紫外线照射的耐受性或抗性。所述活性物质还可用于以较高的产率,例如改进的光合作用效率或改进的营养摄取而著称的转基因植物。

[0698] 优选将本发明的式(I)化合物或其盐用于以下植物的经济上重要的转基因作物中:有用植物和观赏植物,例如谷类,如小麦、大麦、黑麦、燕麦、黍、稻、木薯和玉米;或其它作物,如甜菜、棉花、大豆、油菜、马铃薯、番茄、豌豆和其它蔬菜。

[0699] 优选地将式(I)的化合物作为除草剂用于有用植物栽培中,所述植物对除草剂的植物毒性具有抗性或已通过基因技术使所述植物对其具有抗性。

[0700] 产生与现有植物相比具有修饰的特性的新植物的常规方法有,例如传统育种方法和产生突变体。或者,具有修饰的特性的新植物可借助于基因技术而产生(参见,例如EP0221044、EP 0131624)。例如,一些文件已描述了下列方法:

[0701] -对作物植物的基因技术修饰以修饰植物中所合成的淀粉(例如WO 92/011376A、WO 92/14827A、WO 91/19806A);

[0702] -转基因作物植物,其对草铵膦(Glufosinate)类(参见例如,EP 0242236A、EP 242246A)、或草甘膦类(WO 92/000377A)、或磺酰脲类(EP0257993A、US 5013659)的某些除草剂或由于“基因堆积”而对这些除草剂的组合物或混合物具有抗性,如转基因作物植物,例如商品名或名称为Optimum™ GAT™的玉米或大豆(草甘膦ALS 耐受)。另外还描述了对合成植物生长激素(例如2,4D)、HRAC 作用模式类别0 和芳基氧基-苯氧基丙酸酯(fops, HRAC,类别A)(DHT,Dow Agrosience Herbicide Tolerance Trait)具有抗性的转基因植物

[0703] -转基因作物植物,例如棉花,具有产生苏云金杆菌毒素(Bacillus thuringiensis toxin,Bt 毒素)的能力,其使植物对某些害虫具有抗性(EP 0142924A、EP 0193259A)。

- [0704] -具有经修饰的脂肪酸组成的转基因作物植物(WO 91/13972A)。
- [0705] -具有新的抗昆虫性的基因技术植物,例如基于对来自光杆菌(*Photobacterium*) 的毒素、来自昆虫病原线虫(entomopathogenic Nematoden) 的致病杆菌(*Xenorhabdus*) 共生体和来自蜘蛛、蝎、蚂蚁、寄生蜂的毒素的表达的基因修饰植物。
- [0706] -具有新的成分或次生代谢物(例如新的植物抗毒素,其使抗病性提高) 的经基因技术改变的作物植物(EP 309862A、EP0464461A)
- [0707] -具有更高产率和更高胁迫耐受性的具有降低的光呼吸作用的经基因技术改变的植物(EP 0305398A)
- [0708] -产生制药上或诊断上重要的蛋白质(“分子农业医药”) 的转基因作物植物
- [0709] -特点为较高产率或更好品质的转基因作物植物
- [0710] -特点为提高的对非生物和生物胁迫的耐受性的转基因作物植物
- [0711] -特点为例如具有上述新特性的结合(“基因堆积”)的转基因作物植物。
- [0712] 许多可用于产生具有修饰的特性的新转基因植物的分子生物技术原则上是已知; 见例如I.Potrykus 及G.Spangenberg (编辑) *Gene Transfer to Plants*, Springer Lab Manual(1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg. 或Christou, “Trends in Plant Science” 1 (1996)423-431。
- [0713] 为了进行此类基因技术操作,可将核酸分子引入质粒,其能够通过重组DNA 序列而产生突变或序列改变。例如,可借助标准方法进行碱基置换、部分序列移除或者加入天然或合成的序列。为了将DNA 片段彼此连接,可以在片段上加入衔接头或连接体;见,例如 Sambrook 等人,1989, *Molecular Cloning, A Laboratory Manual*, 第2 版, Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY ;或者 Winnacker “Gene und Klone”, VCH Weinheim 第2 版, 1996。
- [0714] 具有降低的基因产物活性的植物细胞的制备可例如通过下列方法实现:通过表达至少一种相应的反义-RNA、用于实现共抑制效应的正义-RNA,或者表达至少一种相应构建的核酶,其特异性裂解上述基因产物的转录物。
- [0715] 为此,可使用含有基因产物的所有编码序列(包括可能存在的任何侧翼序列) 的DNA 分子,或使用仅含有部分编码序列的DNA 分子,其中所述部分必须足够长,以便在细胞中产生反义作用。也可使用与基因产物的编码序列具有高度同源性但并不完全相同的DNA 序列。
- [0716] 当在植物中表达核酸分子时,合成的蛋白质可位于植物细胞的任意区室中。但为实现在特定区室中的定位,可例如使编码区域与确保在特定区室中定位的DNA 序列连接。此类序列是本领域技术人员已知的(参见,例如 Braun 等人, *EMBO J.* 11(1992), 3219-3227 ; Wolter 等人, *Proc. Natl. Acad. Sci. USA* 85(1988), 846-850 ; Sonnewald 等人, *Plant J.* 1(1991), 95-106)。核酸分子还可在植物细胞的细胞器中表达。
- [0717] 转基因植物细胞可根据已知技术再生以得到完整植物。原则上,转基因植物可以是任意植物种的植物,即既可以是单子叶植物,也可以是双子叶植物。
- [0718] 因此,可得到由于过表达、阻抑或抑制同源(=天然) 基因或基因序列、或者表达异源(=外源) 基因或基因序列而具有修饰特性的转基因植物。
- [0719] 优选可将本发明化合物(I) 用于对以下物质具有抗性的转基因作物中:生长调节

剂,例如2,4D、麦草畏(Dicamba);或抑制植物必需酶的除草剂,所述植物必需酶例如乙酰辅酶A 羧化酶、乙酰乳酸合酶(ALS)、EPSP 合酶、谷氨酰胺合酶(GS) 或羟苯基丙酮酸双加氧酶(HPPD);或选自FOPs、磺酰脲、草甘膦、草铵膦或苯甲酰基异恶唑类和类似活性物质的除草剂;或这些活性物质的任意组合物。

[0720] 特别优选地将本发明化合物用于对草甘膦与草铵膦、草甘膦与磺酰脲或咪唑烷酮的组合物具有抗性的转基因作物植物。非常特别优选地将本发明用于转基因作物植物,例如具有商品名或名称为OptimumTMGATTM(草甘膦ALS 耐受)的玉米或大豆。此外且特别优选本发明化合物用于对具有“HRAC 作用模式类别0”的合成植物生长激素(例如2,4D)和具有“HRAC 作用模式类别A”(例如DHT,Dow Agroscience Herbicide Tolerance Trait)的芳基氧基-苯氧基丙酸酯(fops)具有抗性的转基因植物。

[0721] 当本发明活性物质用于转基因作物时,除了可在其它作物中观察到的对有害植物的效果之外,还常常产生对施用于所述转基因作物而言特异性的效果,例如改变的或特别拓宽的可防治杂草的范围、改变的可用于施用的施用量、优选地与转基因作物对其具有抗性的除草剂的良好结合能力以及对转基因作物植物的生长和产率的影响。

[0722] 因此本发明的主题也是本发明的式(I) 化合物作为除草剂用于防治转基因作物植物中有害植物的用途。

[0723] 本发明化合物可以以可湿性粉剂、可乳化浓缩剂、可喷雾液剂、粉末剂或颗粒剂形式以常规制剂使用。因此,本发明的主题也是含有本发明化合物的除草和植物生长调节药剂。

[0724] 根据所需的生物学和/或化学-物理参数,本发明的化合物可以多种方式配制。可能的剂型包括,例如:可湿性粉剂(WP)、水溶性粉剂(SP)、水溶性浓缩剂、可乳化浓缩剂(EC)、乳剂(EW),如水包油乳剂和油包水乳剂,可喷雾液剂、悬浮浓缩剂(SC)、油基或水基分散体、油混溶性溶液剂、胶囊悬浮剂(CS)、粉末剂(DP)、拌种剂、用于撒播-和土壤施用的颗粒剂,微颗粒、喷雾颗粒剂、包衣颗粒剂和吸附颗粒剂形式的颗粒剂(GR),水分散性颗粒剂(WG)、水溶性颗粒剂(SG)、ULV-制剂、微胶囊剂和蜡剂。

[0725] 这些各种剂型在原则上均是已知的,并在例如下列文献中有所描述:Winnacker-Küchler,“Chemische Technologie”,卷7,C.Hanser Verlag 慕尼黑,第4 版,1986 ;Wade van Valkenburg,“Pesticide Formulations”,Marcel Dekker,N.Y.,1973 ;K.Martens,“Spray Drying” Handbook,第3 版,1979,G.Goodwin Ltd. London。

[0726] 所需制剂助剂如惰性材料、表面活性剂、溶剂和其它添加剂也是已知的并在例如下列文献中有所描述:Watkins,“Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers”,第2 版,Darland Books,Caldwell N.J.,H.v.Olphen,“Introduction to Clay Colloid Chemistry”;第2 版,J.Wiley&Sons,N.Y. ;C. Marsden,“Solvents Guide”;第2 版,Interscience,N.Y.1963 ;McCutcheon’s “Detergents and Emulsifiers Annual”,MC Publ.Corp.,Ridgewood N.J. ;Sisley 和 Wood,“Encyclopedia of Surface Active Agents”,Chem.Publ.Co.Inc.,N.Y.1964 ;Schönfeldt,“Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte”,Wiss.Verlagsgesell.,Stuttgart 1976 ;Winnacker-Küchler,“Chemische Technologie”,卷7,C.Hanser Verlag 慕尼黑,第4 版,1986。

[0727] 基于这些剂型,还可与其它农药活性物质,例如杀昆虫剂、杀螨剂、除草剂、杀真菌

剂,以及与安全剂、肥料和/或生长调节剂,例如以成品制剂或罐混物的形式制备组合物。

[0728] 作为混合物制剂中或罐混物中本发明活性物质的组合物参与物例如可使用基于抑制例如下述酶的已知活性物质:乙酰乳酸合酶、乙酰辅酶A羧化酶、纤维素合酶、烯醇丙酮酰莽草酸-3-磷酸合酶、谷氨酰胺合酶、对羟基苯基丙酮酸双加氧酶、八氢番茄红素脱氢酶(Phytoendesaturase)、光系统I、光系统II、原卟啉原氧化酶,如其描述于例如Weed Research 26 (1986) 441-445 或 "The Pesticide Manual", 第13版,The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2003 和在其中引用的文献中。

[0729] 作为可与本发明的化合物组合的已知除草剂或植物生长调节剂可提及例如下述活性物质:

[0730] 乙草胺(Acetoachlor)、Acibenzolar、阿拉酸式-S-甲基(Acibenzolar-S-methyl)、三氟羧草醚(Acifluorfen)、三氟羧草醚-钠(Acifluorfen-钠)、苯草醚(Aclonifen)、甲草胺(Alachlor)、二丙烯草胺(Allidochlor)、禾草灭(Alloxydim)、禾草灭钠(Alloxydim-钠)、莠灭净(Ametryn)、氨唑草酮(Amicarbazone)、呋喃丹(Amidochlor)、酰嘧磺隆(Amidosulfuron)、氯氨吡啶酸(Aminopyralid)、杀草强(Amitrole)、氨基磺酸铵(Ammoniumsulfamat)、环丙嘧啶醇(Ancymidol)、莎稗磷(Anilofos)、黄草灵(Asulam)、莠去津(Atrazine)、唑啶草酮(Azafenidin)、四唑嘧磺隆(Azimsulfuron)、叠氮津(Aziprotryn)、BAH-043、BAS-140H、BAS-693H、BAS-714H、BAS-762H、BAS-776H、BAS-800H、氟丁酰草胺(Beflubutamid)、草除灵(Benazolin)、草除灵-乙酯(Benazolin-ethyl)、Bencarbazone、氟草胺(Benfluralin)、呋草黄(Benfuresate)、地散磷(Bensulide)、苄嘧磺隆-甲酯(Bensulfuron-methyl)、灭草松(Bentazone)、双苯嘧草酮(Benzfendizone)、双环磺草酮(Benzobicyclon)、吡草酮(Benzofenap)、氟草黄(Benzofluor)、Benzoylprop、治草醚(Bifenox)、双丙氨酰磷(Bilanafos)、双丙氨酰磷钠(Bilanafos-sodium)、Bispyribac、双草醚(Bispyribac-sodium)、除草定(Bromacil)、溴丁酰草胺(Bromobutide)、溴酚脞(Bromofenoxim)、溴草腈(Bromoxynil)、Bromuron、Buminafos、羟草酮(Busoxinone)、丁草胺(Butachlor)、氟丙嘧草酯(Butafenacil)、抑草磷(Butamifos)、丁烯草胺(Butenachlor)、仲丁灵(Butralin)、丁氧环酮(Butroxydim)、丁草特(Butylate)、唑草胺(Cafenstrole)、双酰草胺(Carbetamide)、Carfentrazone、唑草酮(Carfentrazone-ethyl)、甲氧除草醚(Chlormethoxyfen)、草灭畏(Chloramben)、Chlorazifop、Chlorazifop-butyl、氯溴隆(Chlorbromuron)、氯草灵(Chlorbufam)、伐草克(Chlorfenac)、伐草克钠(Chlorfenac-natrium)、燕麦酯(Chlorfenprop)、整形醇(Chlorflurenol)、整形素(Chlorflurenol-methyl)、氯草敏(Chloridazon)、氯嘧磺隆(酸)(Chlorimuron)、氯嘧磺隆(Chlorimuron-ethyl)、矮壮素(Chlormequat-chloride)、草枯醚(Chlornitrofen)、氯酞酰亚胺(Chlorophthalim)、敌草索(Chlorthal-dimethyl)、绿麦隆(Chlorotoluron)、氯磺隆(Chlorsulfuron)、Cinidon、吡啶酮草酯(Cinidon-ethyl)、环庚草醚(Cinmethylin)、醚磺隆(Cinosulfuron)、烯草酮(Clethodim)、游离炔草酸(Clodinafop)、炔草酯(Clodinafop-propargyl)、苯哒嗪酸(Clofencet)、异草酮(Clomazone)、氯甲酰草胺(Clomeprop)、坐果安(Cloprop)、氯草啶(Clopyralid)、Cloransulam、氯酯磺草胺(Cloransulam-methyl)、苄草隆(Cumyluron)、氨脞(Cyanamide)、草净津(Cyanazine)、环丙

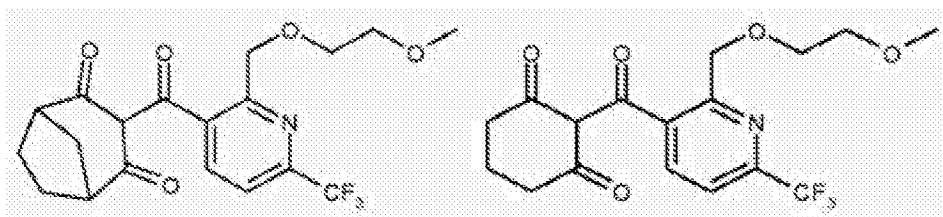
酰草胺(Cyclanilide)、环草敌(Cycloate)、环丙嘧磺隆(Cyclosulfamuron)、噻草酮(Cycloxydim)、环莠隆(Cycluron)、Cyhalofop、氰氟草酯(Cyhalofop-butyl)、牧草快(Cyperquat)、环草津(Cyprazine)、三环赛草胺(Cyprazole)、2,4-D、2,4-DB、杀草隆/汰草龙(Daimuron/dymron)、茅草枯(Dalapon)、丁酰肼(Daminozide)、棉隆(Dazomet)、正癸醇、甜菜安(Desmedipham)、敌草净(Desmetryn)、Detosyl-Pyrazolate (DTP)、燕麦敌(Diallate)、麦草畏(Dicamba)、敌草腈(Dichlobenil)、2,4-滴丙酸(Dichlorprop)、对-2,4-滴丙酸(Dichlorprop-P)、禾草灵酸(Diclofop)、禾草灵(Diclofop-methyl)、精吡氟禾草灵(Diclofop-P-methyl)、双氯磺草胺(Diclosulam)、乙酰甲草胺酸(Diethatyl)、乙酰甲草胺(Diethatyl-ethyl)、枯莠隆(Difenoxuron)、野燕枯(Difenzoquat)、吡氟酰草胺(Diflufenican)、氟吡草腈(Diflufenzopyr)、二氟吡隆(Diflufenzopyr-sodium)、丁噁隆(Dimefuron)、敌草克钠(Dikegulac-sodium)、丁噁隆(Dimefuron)、哌草丹(Dimepiperate)、二甲草胺(Dimethachlor)、戊草津(Dimethametryn)、二甲吩草胺(Dimethenamid)、高效噁吩草胺(Dimethenamid-P)、噁节因(Dimethipin)、醚黄隆(Dimtrasulfuron)、氨基灵(Dinitramine)、地乐酚(Dinoseb)、特乐酚(Dinoterb)、双苯酰草胺(Diphenamid)、异丙净(Dipropetryn)、敌草快(Diquat)、二溴敌草快(Diquat dibromide)、氟硫草定(Dithiopyr)、敌草隆(Diuron)、DNOC、克菊特(Eglinazine-ethyl)、茵多酸(Endothal)、EPTC、戊草丹(Esprocarb)、乙丁烯氟灵(Ethalfluralin)、甲基胺苯磺隆(Ethametsulfuron-methyl)、乙烯利(Ethephon)、磺噻隆(Ethidimuron)、乙噻草酮(Ethiozin)、乙氧呋草黄(Ethofumesate)、氯氟草醚(Ethoxyfen)、氯氟草醚乙酯(Ethoxyfen-ethyl)、乙氧磺隆(Ethoxysulfuron)、乙氧苯草胺(Etobenzanid)、F-5331,即N-[2-氯-4-氟-5-[4-(3-氟丙基)-4,5-二氢-5-氧-1H-四唑-1-基]-苯基]乙磺酰胺、涕丙酸(Fenoprop)、噁唑禾草灵(Fenoxaprop)、精噁唑禾草灵(Fenoxaprop-P)、噁唑禾草灵乙酯(Fenoxaprop-ethyl)、精噁唑禾草灵乙酯(Fenoxaprop-P-ethyl)、四唑酰草胺(Fentrazamide)、非草隆(Fenuron)、麦草伏(Flamprop)、高效麦草氟异丙酯(Flamprop-M-isopropyl)、高效麦草氟甲酯(Flamprop-M-methyl)、啶嘧磺隆(Flazasulfuron)、双氟磺草胺(Florasulam)、吡氟禾草灵(Fluazifop)、精吡氟禾草灵(Fluazifop-P)、吡氟禾草灵丁酯(Fluazifop-butyl)、精吡氟禾草灵丁酯(Fluazifop-P-butyl)、异丙吡草酯(Fluazolate)、氟酮磺隆(Flucarbazone)、氟酮磺隆钠(Flucarbazone-sodium)、氟吡磺隆(Flucetosulfuron)、氟消草(Fluchloralin)、氟噻草胺(Flufenacet (Thiaflumide))、Flufenpyr、氟吡嗪草酯(Flufenpyr-ethyl)、氟节胺(Flumetralin)、唑嘧磺草胺(Flumetsulam)、氟烯草酸(Flumiclorac)、氟胺草酯(Flumiclorac-pentyl)、丙炔氟草胺(Flumioxazin)、炔草胺(Flumipropyn)、伏草隆(Fluometuron)、硝草醚(Fluorodifen)、乙羧氟草醚酸(Fluoroglycofen)、乙羧氟草醚乙酯(Fluoroglycofen-ethyl)、氟胺草唑(Flupoxam)、Flupropacil、四氟丙酸(Flupropanate)、Flupyrsulfuron、氟啶嘧磺隆(Flupyrsulfuron-methyl-sodium)、抑草丁(Flurenol)、苋醇丁酯(Flurenol-butyl)、氟啶草酮(Fluridone)、氟咯草酮(Flurochloridone)、氯氟吡氧乙酸(Fluroxypyr)、氯氟吡氧乙酸酯(Fluroxypyr-meptyl)、呋嘧醇(Flurprimidol)、呋草酮(Flurtamone)、Fluthiacet、氟噻甲草酯(Fluthiacet-methyl)、氟唑草胺(Fluthiamide)、氟磺胺草醚(Fomesafen)、甲酰胺磺隆(Foramsulfuron)、氯吡脲(Forchlorfenuron)、杀木膦(Fosamine)、呋氧草醚

(Furyloxyfen)、赤霉酸(Gibberellinsäure)、草铵膦(Glufosinate)、L-草铵膦(L-Glufosinate)、L-草铵膦铵盐(L-Glufosinate-ammonium)、草铵膦铵盐(Glufosinate-ammonium)、草甘膦(Glyphosate)、草甘膦异丙基铵盐(Glyphosate-isopropylammonium)、H-9201、Halosafen、氯吡嘧磺隆(Halosulfuron)、氯吡嘧磺隆甲酯(Halosulfuron-methyl)、氟吡甲禾灵(Haloxyfop)、高效氟吡甲禾灵(Haloxyfop-P)、吡氟氯禾灵-乙氧基乙酯(Haloxyfop-P-ethoxyethyl)、吡氟氯禾灵-甲酯(Haloxyfop-methyl)、高效吡氟氯禾灵-甲酯(Haloxyfop-P-methyl)、环嗪酮(Hexazinone)、HNPC-9908、HOK-201、HW-02、咪草酸(Imazamethabenz)、咪草酸甲酯(Imazamethabenz-methyl)、咪草啞酸(Imazamox)、甲基咪草烟(Imazapic)、灭草烟(Imazapyr)、咪唑喹啉酸(Imazaquin)、咪唑乙烟酸(Imazethapyr)、咪唑磺隆(Imazosulfuron)、抗倒胺(Inabenzide)、茚草酮(Indanofan)、吲哚乙酸(IAA)、4-吲哚-3-基丁酸(IBA)、碘甲磺隆(Iodosulfuron)、甲基碘磺隆钠盐(Iodosulfuron-methyl-sodium)、碘苯腈(Ioxynil)、草特灵(Isocarbamid)、异丙乐灵(Isopropalin)、异丙隆(Isoproturon)、异恶隆(Isouron)、异噁酰草胺(Isoxaben)、异噁氯草酮(Isoxachlortole)、异噁唑草酮(Isoxaflutole)、异噁草醚(Isoxapyrifop)、IDH-100、KUH-043、KUH-071、特胺灵(Karbutilate)、Ketospiradox、乳氟禾草灵(Lactofen)、环草啞(Lenacil)、利谷隆(Linuron)、抑芽素(Maleic hydrazide)、MCPA、MCPB、MCPAB甲酯、-乙酯和-钠盐、2-甲-4-氯苯氧丙酸(Mecoprop)、2-甲-4-氯苯氧丙酸钠、2-甲-4-氯苯氧丙酸丁氧基乙酯(Mecoprop-butotyl)、高-2-甲-4-氯苯氧丙酸丁氧基乙酯(Mecoprop-P-butotyl)、高-2-甲-4-氯苯氧丙酸二甲基铵(Mecoprop-P-dimethylammonium)、高-2-甲-4-氯苯氧丙酸-2-乙基己酯(Mecoprop-P-2-ethylhexyl)、高-2-甲-4-氯苯氧丙酸钾(Mecoprop-P-potassium)、苯噻酰草胺(Mefenacet)、氟磺酰草胺(Mefluidide)、甲哌鎗(Mepiquat chloride)、Mesosulfuron、甲基二磺隆(Mesosulfuron-methyl)、甲基磺草酮(Mesotrione)、噻唑隆(Methabenzthiazuron)、威百亩(Metam)、噁唑酰草胺(Metamifop)、苯噻草酮(Metamitron)、吡草胺(Metazachlor)、灭草定(Methazole)、去草酮(Methoxyphenone)、甲基杀草隆(Methyldymron)、1-甲基环丙烯、异硫氰酸甲酯、吡喃隆(Metobenzuron)、溴谷隆(Metobromuron)、异丙甲草胺(Metolachlor)、精-异丙甲草胺(S-Metolachlor)、磺草啞胺(Metosulam)、甲氧隆(Metoxuron)、噻草酮(Metribuzin)、甲磺隆(Metsulfuron)、甲磺隆-甲酯(Metsulfuron-methyl)、禾草敌(Molinate)、庚酰草胺(Monalide)、Monocarbamide、硫酸二氢单脲(Monocarbamide dihydrogensulfate)、绿谷隆(Monolinuron)、单嘧磺酯(Monosulfuron)、灭草隆(Monuron)、MT 128、MT-5950,即N-[3-氯-4-(1-甲基乙基)苯基]-2-甲基戊酰胺、NGGC-011、萘丙胺(Naproanilide)、敌草胺(Napropamide)、萘草胺(Naptalam)、NC-310,即4-(2,4-二氯苯甲酰基)-1-甲基-5-吡氧基吡啶,草不隆(Neburon)、烟嘧磺隆(Nicosulfuron)、氟氯草胺(Nipyraclofen)、甲磺乐灵(Nitralin)、除草醚(Nitrofen)、复硝酚钠(Nitrophenolate-sodium (异构体混合物))、三氟甲草醚(Nitrofluorfen)、壬酸、氟草敏(Norflurazon)、坪草丹(Orbencarb)、噻苯胺磺隆(Orthosulfamuron)、氧磺乐灵(Oryzalin)、稻思达(Oxadiargyl)、噁草酮(Oxadiazon)、环氧嘧磺隆(Oxasulfuron)、去稗安(Oxaziclomefone)、乙氧氟草醚(Oxyfluorfen)、多效唑(Paclobutrazole)、百草枯(Paraquat)、二氯百草枯(Paraquat dichloride)、壬酸、二甲戊乐灵(Pendimethalin)、4-(叔丁基)-N-(1-乙基-丙基)-2,6-二硝基-苯胺(Pendralin)、五

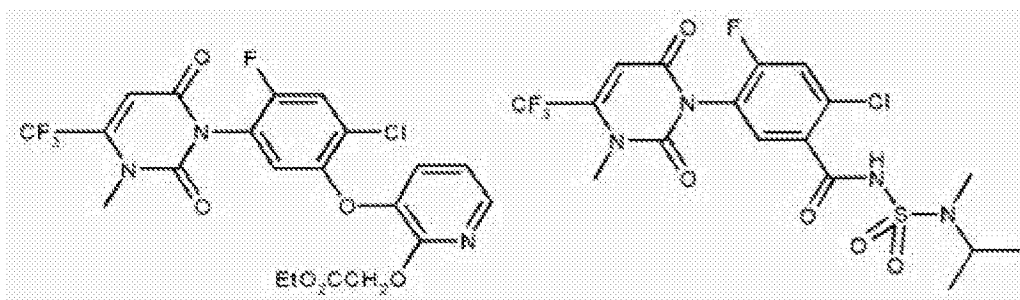
氟磺草胺(Penoxsulam)、甲氯酰草胺(Pentanochlor)、环戊恶草酮(Pentoxazone)、黄草伏(Perfluidone)、烯草胺(Pethoxamid)、棉胺宁(Phenisopham)、甜菜宁(Phenmedipham)、甜菜宁-乙酯(Phenmedipham-ethyl)、胺氯吡啶酸(Picloram)、氟吡酰草胺(Picolinafen)、唑啉草酯(Pinoxaden)、哌草磷(Piperophos)、Pirifenop、Pirifenop-butyl、丙草胺(Pretilachlor)、氟嘧磺隆酸(Primisulfuron)、氟嘧磺隆-甲酯(Primisulfuron-methyl)、烯丙苯噻唑(Probenazole)、氟唑草胺(Profluazole)、环丙腈津(Procyazine)、氨基丙氟灵(Prodiamine)、氟乐灵(Prifluraline)、环苯草酮(Profoxydim)、调环酸(Prohexadione)、调环酸钙(Prohexadione-calcium)、茉莉酮(Prohydrojasmon)、扑灭通(Prometon)、扑草净(Prometryn)、毒草胺(Propachlor)、敌稗(Propanil)、噁草酸(Propaquizafop)、扑灭津(Propazine)、苯胺灵(Propham)、异丙草胺(Propisochlor)、丙苯磺隆(Propoxycarbazone)、丙苯磺隆-钠(Propoxycarbazone-sodium)、戊炔草胺(Propyzamide)、甲硫磺乐灵(Prosulfalin)、苄草丹(Prosulfocarb)、氟磺隆(Prosulfuron)、丙炔草胺(Prynachlor)、双唑草腈(Pyraclonil)、吡草醚(Pyraflufen)、吡草醚-乙酯(Pyraflufen-ethyl)、吡唑解草酯(Pyrasulfotole)、苄草唑(Pyrazolynate)(吡唑特(Pyrazolate))、吡嘧磺隆-乙酯(Pyrazosulfuron-ethyl)、苄草唑(Pyrazoxyfen)、Pyribambenz、异丙酯草醚(Pyribambenz-isopropyl)、嘧啶肟草醚(Pyribenzoxim)、稗草丹(Pyributicarb)、Pyridafol、哒草特(Pyridate)、环酯草醚(Pyriftalid)、嘧草醚(Pyriminobac)、嘧草醚-甲酯(Pyriminobac-methyl)、吡丙醚(Pyrimisulfan)、嘧硫草醚(Pyriithiobac)、嘧硫草醚钠(Pyriithiobac-sodium)、Pyroxasulfone、甲氧磺草胺(Pyroxsulam)、二氯喹啉酸(Quinclorac)、氯甲喹啉酸(Quinmerac)、灭藻醌(Quinoclamine)、喹禾灵(Quizalofop)、喹禾灵-乙酯(Quizalofop-ethyl)、精喹禾灵(Quizalofop-P)、精喹禾灵-乙酯(Quizalofop-P-ethyl)、喹禾糠酯(Quizalofop-P-tefuryl)、砒嘧磺隆(Rimsulfuron)、仲丁通(Sebumeton)、烯禾啉(Sethoxydim)、环草隆(Siduron)、西玛津(Simazine)、西草净(Simetryn)、SN-106279、磺草酮(Sulcotrione)、菜草畏(Sulfallate (CDEC))、甲基磺酰甲胺(Sulfentrazone)、甲嘧磺隆(Sulfometuron)、甲嘧磺隆-甲酯(Sulfometuron-methyl)、草硫膦(Sulfosate)(草甘膦三甲基硫盐(Glyphosate-trimesium))、磺酰磺隆(Sulfosulfuron)、SYN-523、SYP-249、SYP-298、SYP-300、牧草胺(Tebutam)、丁噻隆(Tebuthiuron)、四氯硝基苯(Tecnazene)、特呋三酮(Tefuryltrione)、环磺酮(Tembotrione)、得杀草(Tepaloxym)、特草定(Terbacil)、特草灵(Terbucarb)、特丁草胺(Terbuchlor)、特丁通(Terbumeton)、特丁津(Terbuthylazine)、特丁净(Terbutryn)、TH-547、噻吩草胺(Thenylchlor)、氟噻草胺(Thiaflumide)、噻氟隆(Thiazafluron)、噻草定(Thiazopyr)、噻二唑草胺(Thidiazimin)、噻苯隆(Thidiazuron)、噻酮磺隆(Thiencarbazone)、噻酮磺隆-甲酯(Thiencarbazone-methyl)、噻吩磺隆(Thifensulfuron)、甲基噻吩磺隆(Thifensulfuron-methyl)、杀草丹(Thiobencarb)、丁草威(Tiocarbazil)、苯吡唑草酮(Toprimezone)、三甲苯草酮(Tralkoxydim)、野麦畏(Triallate)、醚苯磺隆(Triasulfuron)、三嗪氟草胺(Triaziflam)、Triazofenamide、苯磺隆(Tribenuron)、甲基苯磺隆(Tribenuron-methyl)、三氯乙酸(TCA)、绿草定(Triclopyr)、灭草环(Tridiphane)、草达津(Trietazine)、三氟啶磺隆(Trifloxysulfuron)、三氟啶磺隆钠盐(Trifloxysulfuron-sodium)、氟乐灵

(Trifluralin)、氟胺磺隆酸(Triflusulfuron)、氟胺磺隆-甲酯(Triflusulfuron-methyl)、三甲隆(Trimeturon)、抗倒酯酸(Trinexapac)、抗倒酯(Trinexapac-ethyl)、三氟甲磺隆(Tritosulfuron)、Tsitodef、烯效唑(Uniconazole)、烯效唑-P(Uniconazole-P)、灭草猛(Vernolate)、ZJ-0166、ZJ-0270、ZJ-0543,或ZJ-0862以及下列化合物

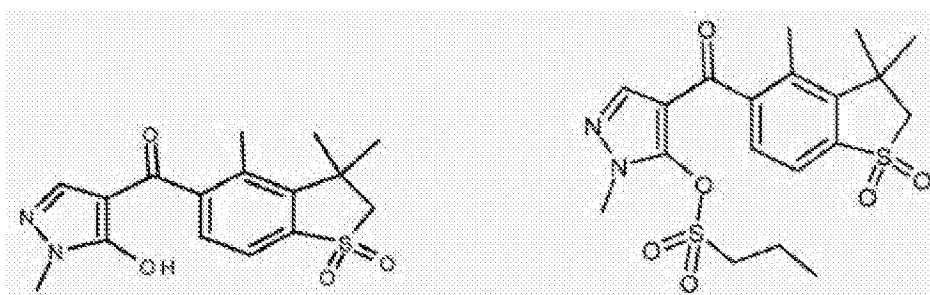
[0731]



[0732]



[0733]



[0734] 化合物或者用根据国际标准化组织 (ISO)的“常见名称”或者用其化学名称或编码数命名并且总是包括其所有使用形式如酸、盐、酯或变体,如异构体、立体异构体和光学异构体。示例性提及一种或多种应用形式或变体。

[0735] 可湿性粉剂是可均匀分散在水中的制剂,除了活性物质而外,其还包含除稀释剂或惰性物质以外的离子型和/或非离子型的表面活性剂(润湿剂、分散剂),例如聚氧乙基化的烷基酚,聚氧乙基化的脂肪醇,聚氧乙基化的脂肪胺,脂肪醇聚二醇醚硫酸酯,链烷磺酸酯/盐,烷基苯磺酸酯/盐,木质素磺酸钠,2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸钠,二丁基萘磺酸钠或油酰基甲基牛磺酸钠。为了制备可湿性粉剂,将除草活性物质例如在常规设备如锤式磨机、鼓风磨机和射流式磨机中精细研磨,并同时或随后与制剂助剂一起混合。

[0736] 可乳化浓缩剂通过下述过程制备:加入一种或多种离子型和/或非离子型表面活性剂(乳化剂),将活性物质溶于有机溶剂,例如丁醇、环己酮、二甲基甲酰胺、二甲苯或者高沸点芳香化合物或烃类或这些有机溶剂的混合物中。可用的乳化剂有例如:烷基芳基磺酸的钙盐,如十二烷基苯磺酸钙;或非离子型乳化剂,如脂肪酸聚乙二醇酯类、烷基芳基聚乙二醇醚类、脂肪醇聚乙二醇醚类、环氧丙烷-环氧乙烷-缩合产物、烷基聚醚类、脱水山梨糖酯类例如脱水山梨糖脂肪酸酯或聚氧乙烯脱水山梨糖酯类例如聚氧乙烯脱水山梨糖脂肪酸酯。

[0737] 粉剂通过将活性物质与细分散的固体物质一起研磨而获得,所述固体物质例如滑石,天然粘土如高岭土、膨润土和叶蜡石,或硅藻土。

[0738] 悬浮浓缩剂可为水基的或油基的。它们可以通过例如使用市售的珠磨机湿法研磨来制备,并任选加入表面活性剂,如上文例如在其它剂型中已经说明的表面活性剂。

[0739] 乳剂,例如水包油乳剂(EW),可以例如借助搅拌器、胶体磨和/或静态混合器使用水性有机溶剂和任选的表面活性剂(如上文例如在其它剂型中已经说明的表面活性剂)来制备。

[0740] 颗粒剂可以通过将所述活性物质喷洒在有吸附能力的经造粒的惰性材料上来制备,或者通过借助粘合剂将活性物质浓缩物施加在载体物质(如砂、高岭土)或经造粒的惰性材料的表面上来制备,所述粘合剂例如为聚乙烯醇、聚丙烯酸钠或矿物油。也可以以制备肥料颗粒的常规方式将合适的活性物质造粒—若需要可以与肥料混合造粒。

[0741] 水分散性颗粒剂通常以常规方法无固体惰性物质地制备,所述常规方法如喷雾干燥法、流化床制粒法、圆盘式制粒法、用高速混合器混合以及挤出。

[0742] 为了制备圆盘式法颗粒、流体床法颗粒、挤出法粒和喷雾法颗粒,参见例如“Spray-Drying Handbook”第3版,1979,G.Goodwin Ltd.,London;J.E.Browning,“Agglomeration”,Chemical and Engineering 1967,第147页及其以后几页;“Perry’s Chemical Engineer’s Handbook”,第5版,McGraw-Hill,New York 1973,8-57页中的方法。

[0743] 关于植物保护剂制剂的更多细节,参见例如G.C.Klingman,“Weed Control as a Science”,John Wiley and Sons,Inc.,New York,1961,81-96页和J.D.Freyer, S.A.Evans,“Weed Control Handbook”,第5版,Blackwell Scientific Publications, Oxford,1968,101-103页。

[0744] 所述农业化学制剂含有通常0.1至99重量%、特别是0.1至95重量%的本发明化合物。

[0745] 在可湿性粉剂中,活性物质浓度为例如约10至90重量%,至100重量%的余量由常规制剂成分组成。在可乳化浓缩剂中,活性物质浓度可为约1至90重量%、优选地为5至80重量%。粉剂状的制剂中含有1至30重量%的活性物质,常常优选至少5至20重量%的活性物质;可喷雾溶液剂中含有约0.05至80、优选地为2至50重量%的活性物质。在水分散性颗粒剂中,活性物质含量部分取决于所述活性化合物以固体形式还是液体形式存在,和使用何种制粒助剂、填充剂等。在水中可分散的颗粒剂中,活性物质含量为例如1至95重量%、优选10至80重量%。

[0746] 此外,所述活性物质制剂任选地含有各自常用的粘合剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、渗透剂、防腐剂、防冻剂和溶剂、填料、载体和着色剂、消泡剂、挥发抑制剂以及影响pH值和粘度的试剂。

[0747] 根据本发明的处理方法优选用于遗传修饰生物,例如,植物或植物部分。

[0748] 遗传修饰植物,所谓的转基因植物,是指异源基因已经被稳定整合到基因组中的植物。

[0749] 表述“异源基因”基本上是指这样一种基因,其在植物以外提供或装配,并在引入核基因组、叶绿体基因组或线粒体基因组中时可以通过表达目的蛋白或多肽或者通过下调

或沉默植物中存在的一种或多种其它基因(例如借助于反义技术、共抑制技术或RNAi-技术[RNA干扰])赋予所转化的植物新的或改善的农学或其它特性。位于基因组中的异源基因同样被称为转基因。由其在植物基因组中特定存在定义的转基因称为转化-或转基因事件。

[0750] 依据植物种类或植物品种、其位置及其生长条件(土壤、气候、生长期、营养),根据本发明的处理还可产生超加性(“协同”)效应。由此,可以实现例如如下超过实际预期的效果:降低根据本发明可使用的活性物质和组合物的施用量和/或拓宽其活性谱和/或提高其活性、改善植物生长、提高高温或低温耐受性、提高对干旱或者对水含量或土壤盐含量的耐受性、提高开花效率(*Blühleistung*)、使采收容易、加速成熟、提高采收产率、果实更大、植株更高、叶色更绿、开花更早、采收产品的品质更高和/或营养价值更高、果实中的糖浓度更高、改善采收产品的贮存能力和/或可加工性能。

[0751] 以某些施用量,根据本发明的活性物质还可能对植物产生强化作用。因此,它们适于调动植物的防御系统来对抗不希望的植物病原性真菌和/或微生物和/或病毒的侵害。这可能是根据本发明的组合例如对真菌的活性提高的可能的原因之一。在本文中,植物强化(抗性诱导)物质也意指这样的物质或物质结合,其能够如此刺激植物的防御系统,以至于当随后被不希望的植物病原性真菌和/或微生物和/或病毒感染时,经处理的植物显示出对不希望的植物病原性真菌和/或微生物和/或病毒的相当大的抵抗度。在这种情况下,将不希望的植物病原性真菌和/或微生物和/或病毒理解为植物病原性真菌、细菌和病毒。因此,根据本发明的物质可以用于在处理后的一段时间内保护植物对抗上述提到的病原体的侵害。在以该活性物质处理植物之后,获得保护效果的时间通常持续1到10天,优选1到7天。

[0752] 优选根据本发明处理的植物和植物品种包括所有提供遗传物质的植物,所述遗传物质赋予植物特别有利的、有用的特征(无论是通过育种和/或生物工程获得)。

[0753] 此外优选根据本发明处理的植物和植物品种耐受一种或多种生物胁迫,即所述植物对动物和微生物有害物(如线虫类、昆虫、螨类、植物病原性真菌、细菌、病毒和/或类病毒)具有改进的抵御。

[0754] 除了上述的植物和植物品种而外,也可根据本发明处理耐受一种或多种非生物胁迫的那些。

[0755] 非生物胁迫条件可包括,例如,干旱、低温条件、热条件、渗透胁迫、涝、增加的土壤盐含量、增加的矿物曝露、臭氧条件、强光条件、氮养分有限的可利用率、磷养分有限的可利用率或者避免遮光。

[0756] 同样可根据本发明处理的植物和植物品种是特点为提高的产量特性的那些植物。在这些植物的情况下,提高的产量可以归因于,例如,改进的植物生理、改进的植物生长和改进的植物发育(如水分利用效率、保水效率)、改进的氮利用、提高的碳素同化作用、改进的光合作用、提高的发芽力以及加速成熟。此外,产量会受改进的植物结构(*Pflanzenarchitektur*)(在胁迫-及非胁迫条件下)的影响,包括提早开花、对生产杂交种子的开花控制、秧苗活力(*Keimpflanzenwüchsigkeit*)、植物大小、节间数和-距离、根系生长、种子大小、果实大小、荚果大小、荚果数或穗数、每个荚果或穗的种子数、种子质量(*Samenmasse*)、提高的种子饱满度、降低的种子传播、降低的荚果开裂和抗倒伏性。其它产量特征包括种子组成,例如碳水化合物含量、蛋白质含量、油含量和油组成、营养价值、对营养不利的化合物的减少、改进的可加工性和改进的可存储性。

[0757] 可根据本发明处理的植物为已经表现出杂种优势或杂交效应的杂交植物,所述杂交植物通常导致更高的产量、更高的活力、更好的健康度和更好的对生物及非生物胁迫因素的抗性。这样的植物通常由一种自交雄性不育株亲系(母系杂交配偶体)与另一种自交雄性性能育亲系(父系杂交配偶体)杂交得到。杂种种子通常从雄性不育株上采收并售给栽培者。雄性不育植物有时(例如,在玉米中)可以通过去雄花穗(即机械去除雄性性器官或雄花)制得;但是,更通常地,雄性不育性由植物基因组中的遗传决定子获得。这种情况下,尤其是当因为希望从杂交植物采收的产品是种子时,确保杂种植物(其含有对雄性不育负责的遗传决定子)的雄性能育性完全恢复通常是有利的。这可以通过确保父系杂交配偶体具有合适的能够恢复杂种植物中雄性能育性的育性恢复基因而实现,所述杂种植物包含造成雄性不育的遗传决定子。雄性不育的遗传决定子可位于细胞质中。细胞质雄性不育(CMS)的实例在例如芸苔属中进行了描述。然而,雄性不育遗传决定子也可以位于核基因组中。雄性不育株也可以通过植物生物技术法例如遗传工程来得到。WO 89/10396描述了一种得到雄性不育株的特别有用的方法,其中例如核糖核酸酶如芽孢杆菌RNA酶在雄蕊中的绒毡层细胞中进行选择性表达。然后能育性可以通过绒毡层细胞中核糖核酸酶抑制剂例如芽孢杆菌RNA酶抑制剂的表达来恢复。

[0758] 可根据本发明处理的植物或植物品种(通过植物生物技术方法例如遗传工程得到)为除草剂耐受性植物,即耐受一种或多种预先给定的除草剂的植物。这样的植物可以通过遗传转化,或通过选择包含赋予上述除草剂耐受性的突变的植物来得到。

[0759] 除草剂耐受性植物是指例如耐受草甘膦的植物,即耐受除草剂草甘膦或其盐的植物。例如,草甘膦耐受性植物可以通过用编码酶5-烯醇丙酮酰基莽草酸-3-磷酸合酶(5-Enolpyruvylshikimate-3-phosphat synthase)(EPSPS)的基因转化植物而获得。这样的EPSPS基因的实例有细菌鼠伤寒沙门菌(*Salmonella typhimurium*)的AroA基因(突变体CT7)、细菌农杆菌(*Agrobacterium sp.*)的CP4基因、编码矮牵牛的EPSPS、番茄的EPSPS或牛筋草(*Eleusine*)的EPSPS的基因。也可以是突变的EPSPS。草甘膦耐受性植物也可以通过表达编码草甘膦氧化还原酶-酶的基因来得到。草甘膦耐受性植物也可以通过表达编码草甘膦乙酰基转移酶-酶的基因来得到。草甘膦耐受性植物也可以通过选择包含上述基因的天然发生突变的植物来得到。

[0760] 其它除草剂耐受性植物是例如那些耐受抑制酶谷氨酰胺合成酶的除草剂如双丙氨膦、草胺膦(Phosphinotricin)或草铵膦(Glufosinate)的植物。所述植物可以通过表达这样的酶来得到,所述酶解除除草剂或者耐受抑制作用的酶谷氨酰胺合成酶突变体的毒性。这样一种有效的解毒酶例如是编码草胺膦乙酰转移酶的酶(例如链霉菌属各种的bar-或pat-蛋白)。表达外源草胺膦乙酰转移酶的植物也有所描述。

[0761] 其它除草剂耐受性植物也可为耐受抑制酶羟基苯丙酮酸双加氧酶(HPPD)的除草剂的植物。羟基苯丙酮酸双加氧酶是催化对羟基苯丙酮酸(HPP)转变为尿黑酸的反应的酶。耐受HPPD抑制剂的植物可以用编码天然存在的耐受HPPD的酶的基因进行转化,或者用编码突变的HPPD酶的基因进行转化。通过用编码某些能形成尿黑酸的酶的基因转化植物,也可以得到对HPPD抑制剂的耐受性,尽管HPPD抑制剂抑制天然的HPPD酶。除了使用编码HPPD耐受酶的基因以外,通过用编码预苯酸脱氢酶的基因转化植物,也可以提高植物对HPPD抑制剂的耐受性。

[0762] 其它除草剂耐受性植物是耐受乙酰乳酸合酶(ALS)抑制剂的植物。已知的ALS抑制剂包括,例如磺酰脲、咪唑啉酮、三唑并嘧啶类、嘧啶基氧基(硫代)苯甲酸酯类和/或磺酰基氨基羰基三唑啉酮除草剂。已知酶ALS(同样被称为乙酰羟酸合酶,AHAS,已知)中不同突变赋予对不同除草剂和除草剂组的耐受性。在国际公开WO 1996/033270中描述了磺酰脲耐受性植物和咪唑啉酮耐受性植物的产生。在例如WO 2007/024782中也描述了其它磺酰脲-和咪唑啉酮耐受性植物。

[0763] 其它除草剂耐受性植物是耐受乙酰辅酶A羧化酶(ACCase)抑制剂的植物。

[0764] 通过诱导的诱变、在除草剂存在下的细胞培养物中的选择或者通过诱变育种,可以得到其它耐受咪唑啉酮和/或磺酰脲的植物。

[0765] 同样可根据本发明处理的植物或植物品种(通过植物生物技术方法如遗传工程得到)是具有昆虫抗性的转基因植物,即对某些目标昆虫的侵害具有抗性的植物。这样的植物可以通过遗传转化得到,或者通过选择包含赋予所述昆虫抗性的突变的植物而得到。

[0766] 本文中的术语“昆虫抗性的转基因植物”包括包含至少一个转基因的任意植物,所述转基因包括编码下列蛋白的编码序列:

[0767] 1) 苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*)的杀虫晶体蛋白或其杀虫部分,诸如在http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/处在线列出的杀虫晶体蛋白或其杀虫部分;例如Cry蛋白类别Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry2Ab、Cry3Ae或Cry3Bb的蛋白或其杀虫部分;或者

[0768] 2) 苏云金芽孢杆菌的晶体蛋白或其部分,所述蛋白或部分在第二种除苏云金芽孢杆菌以外的另外的晶体蛋白或其部分(如由Cy34和Cy35晶体蛋白组成的二元毒素)存在下起杀虫作用;或者

[0769] 3) 包括苏云金芽孢杆菌的两种不同的杀虫晶体蛋白的部分的杀虫杂种蛋白,例如上述1)蛋白的杂合体或上述2)蛋白的杂合体,例如,由玉米品系(Event)MON98034生产的蛋白质Cry1A.105(WO 2007/027777);或者

[0770] 4) 上述点1)到3)中任意一种蛋白质,其中有些,特别是1-10个氨基酸被另一种氨基酸替代以得到更高的对目标昆虫物种的杀虫活性,和/或来扩大受影响目标昆虫物种的范围,和/或由于在克隆或转化过程中引入至编码DNA中的变化,如玉米品系MON863或MON88017中的蛋白质Cry3Bb1,或者玉米品系MIR 604中的蛋白质Cry3A;或者

[0771] 5) 苏云金芽孢杆菌或蜡状芽孢杆菌(*Bacillus cereus*)的杀虫分泌蛋白或其杀虫部分,如列于http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html的起营养作用的昆虫毒性蛋白(营养期杀虫蛋白质,VIP),例如,蛋白质类VIP3Aa的蛋白质;或者

[0772] 6) 苏云金芽孢杆菌或蜡状芽孢杆菌的分泌蛋白,其在苏云金芽孢杆菌或蜡状芽孢杆菌(*B.cereus*)的第二种分泌性蛋白的存在下具有杀虫活性,如由蛋白质VIP1A和VIP2A组成的二元毒素;

[0773] 7) 包括苏云金芽孢杆菌或蜡芽孢杆菌的不同分泌蛋白质的部分的杀虫杂种蛋白,如上述1)蛋白的杂合体或上述2)蛋白的杂合体;或者

[0774] 8) 根据上述点1)至3)的任意一种蛋白质,其中有些,特别是1-10个氨基酸被另一种氨基酸替代以得到更高的对目标昆虫物种的杀虫活性,和/或来扩大相应目标昆虫物

种的范围,和/或由于在克隆或转化过程中引入至编码DNA中的变化(其中保留杀虫蛋白质的编码),如棉花品系COT 102中的蛋白VIP3Aa。

[0775] 当然,在本文中,具有昆虫抗性的转基因植物也包括含有编码上述1-8类中的任意一种蛋白质的基因组合的任何植物。在一个实施方式中,昆虫抗性植物包括多于一种编码根据上述1-8类的任一项的蛋白质的转基因,使用具有对同样的目标昆虫种类具有杀虫活性但是具有不同的作用模式(如结合于昆虫中不同的受体结合位点)的不同蛋白质,以扩大相应的目标昆虫物种的范围或延迟昆虫抗性形成。

[0776] 同样可根据本发明处理的植物或植物品种(通过植物生物技术如遗传工程得到)可耐受非生物胁迫。这类植物可以通过遗传转化,或者通过选择含有赋予植物所述胁迫耐受性的突变的植物而得到。特别有用的具有胁迫耐受性的植物包括:

[0777] a. 含有能降低植物细胞或植物中多腺苷二磷酸核糖聚合酶(PARP)的基因表达和/或活性的转基因的植物;

[0778] b. 含有能降低植物或植物细胞中PARG编码基因的表达和/或活性的促进胁迫耐受性的转基因的植物;

[0779] c. 含有促进胁迫耐受性的转基因的植物,所述基因编码植物中烟酰胺腺嘌呤二核苷酸补救生物合成途径的功能酶,包括烟酰胺酶、烟酸磷酸核糖基转移酶、烟酸单核苷酸腺嘌呤转移酶、烟酰胺腺嘌呤二核苷酸合成酶或烟酰胺磷酸核糖基转移酶。

[0780] 同样可根据本发明处理的植物或植物品种(通过植物生物技术方法如遗传工程得到)表现出改变的收获产物的量、品质和/或贮存能力和/或收获产物的特定成分改变的性质,例如:

[0781] 1) 合成改性淀粉的转基因植物,所述改性淀粉的物理化学性质,特别是直链淀粉的含量或直链淀粉/支链淀粉的比例、支化度、平均链长、侧链的分布、粘性、胶凝强度、淀粉颗粒粒径和/或淀粉颗粒的形态等与在野生型植物细胞或-植物中合成的淀粉相比有所改变,因此改性淀粉更好地适合特定用途。

[0782] 2) 合成非淀粉碳水化合物聚合物或合成与未遗传改性的野生型植物相比性质改变的非淀粉碳水化合物聚合物的转基因植物。实例是产生多聚果糖尤其是菊糖和果聚糖类型的植物,产生 α -1,4-葡聚糖的植物,产生 α -1,6-分枝的 α -1,4-葡聚糖的植物,和产生交替糖(Alternan)的植物。

[0783] 3) 产生透明质酸的转基因植物。

[0784] 同样可根据本发明处理的植物或植物品种(通过植物生物技术方法例如遗传工程得到)是具有改变的纤维性质的植物,如棉株。这些植物可通过遗传转化,或通过选择含有赋予这种改变的纤维性质的突变的植物而得到,包括以下植物:

[0785] a) 植物如棉株,其含有纤维素合成酶基因的变型;

[0786] b) 植物如棉株,其含有rsw2-或rsw3-同源核酸的变型;

[0787] c) 植物如棉株,其具有增加的蔗糖磷酸合酶表达;

[0788] d) 植物如棉株,其具有增加的蔗糖合酶表达;

[0789] e) 植物如棉株,其中纤维细胞基底处胞间连丝开启的时间安排例如通过纤维选择性的 β -1,3-葡聚糖酶的下调而被改变;

[0790] f) 植物如棉株,其具有通过表达包括nodC的N-乙酰基葡萄糖胺转移酶基因和甲质

素合成酶基因而改变了反应性的纤维。

[0791] 同样可根据本发明处理的植物或植物品种(通过植物生物技术方法例如遗传工程得到)是具有改变的油组成特性的植物,如油籽油菜和相关芥属植物。这类植物可通过遗传转化或通过选择含有赋予这种改变的油特性的突变的植物而得到,包括以下植物:

[0792] a) 植物如油籽油菜植物,其产生具有高油酸含量的油;

[0793] b) 植物如油籽油菜植物,其产生具有低亚麻酸含量的油;

[0794] c) 植物如油籽油菜植物,其产生具有低饱和脂肪酸含量的油。

[0795] 可根据本发明来处理的特别有用的转基因植物是具有编码一种或多种毒素的一种或多种基因的植物,是以下列商品名出售的转基因植物:YIELD GARD®(例如玉米、棉花、大豆)、KnockOut®(例如玉米)、BiteGard®(例如玉米)、BT-Xtra®(例如玉米)、StarLink®(例如玉米)、Bollgard®(棉花)、Nucotn®(棉花)、Nucotn 33B®(棉花)、NatureGard®(例如玉米)、Protecta®和NewLeaf®(马铃薯)。可提及的除草剂耐受性植物例如是以下列商品名出售的玉米品种、棉花品种和大豆品种:Roundup Ready®(耐受草甘膦,例如玉米、棉花、大豆)、Liberty Link®(耐受草胺膦,例如油籽油菜)、IMI®(耐受咪唑啉酮)和SCS®(耐受磺酰脲),例如玉米。可提及的除草剂抗性植物(以除草剂耐受的常规方式育种的植物)包括以在Clearfield®名称(例如玉米)下出售的品种。

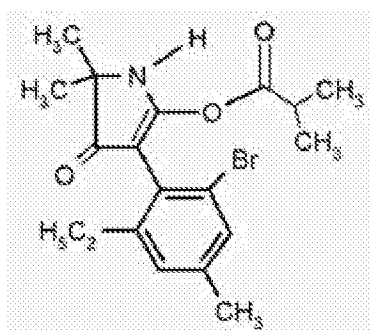
[0796] 可根据本发明处理的特别有用的转基因植物是包含转化品系、或者转化品系的组合的植物,并且其列在例如多个国家或地区的管理机构的数据库中(参见例如http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx和<http://www.agbios.com/dbase.php>)。

[0797] 术语“活性物质”或“化合物”也总是包括这里提及的活性物质组合物。

[0798] 制备实施例

[0799] 实施例 I-a-1

[0800]



[0801] 在室温下,将2 g (2.7 mmol) WO 07/068427的实施例 I-1-a-6的化合物与0.29 g (2.7 mmol) 2-甲基丙酰氯一起预先放入53 ml 甲苯中。在该温度下,非常缓慢地滴加0.36 g (3.5 mmol) 三乙胺。在浓缩并用庚烷/乙酸乙酯溶解后,需要的产物作为固体析出,而异构的酰基化产物保留在溶液中。

[0802] 收率:0.74 g (70% 理论的), 熔点130°C

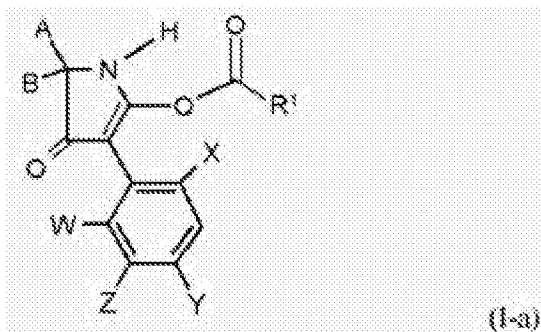
[0803]

¹H-NMR (CDCl₃, 400 MHz): 7.25 (d, 1H), 7.00 (d, 1H), 6.55 (sbr, 1H), 2.65 (sept, 1H), 2.50 (q, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.25 (s, 3H), 1.20 (s, 3H), 1.17 (d, 3H), 1.15 (d, 3H), 1.10 (tr, 3H) ppm.

[0804] ¹³C-NMR (CDCl₃, 400 MHz): 198.8 ppm (羰基)。

[0805] 类似于实施例 (I-a-1) 并根据制备的通用说明得到下式(I-a)的化合物:

[0806]



[0807]

实施例 编号	W	X	Y	Z	A	B	R ¹	熔点 ℃	异构体
I-a-2	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	-(CH ₂) ₇ -CHOCH ₂ -(CH ₂) ₇ -		t-C ₄ H ₉	124 *	β
I-a-3	H	C ₆ H ₅	Br	H	-(CH ₂) ₇ -CHCH ₂ -(CH ₂) ₇ -		t-C ₄ H ₉	*	β
I-a-4	C ₆ H ₅	Cl	Cl	H	-(CH ₂) ₇ -CHCH ₂ -(CH ₂) ₇ -		t-C ₄ H ₉	*	β
I-a-5	CH ₃	C ₆ H ₅	Br	H	-(CH ₂) ₇ -CHOCH ₂ -(CH ₂) ₇ -		t-C ₄ H ₉	*	β
I-a-6	H	C ₆ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₇ -CHCH ₂ -(CH ₂) ₇ -		t-C ₄ H ₉	*	β
I-a-7	CH ₃	C ₆ H ₅	Br	H	-(CH ₂) ₇ -CHCH ₂ -(CH ₂) ₇ -		t-C ₄ H ₉	*	β
I-a-8	C ₆ H ₅	Br	Br	H	-(CH ₂) ₇ -		t-C ₄ H ₉	136	-
I-a-9	C ₆ H ₅	OCH ₃	Cl	H	-(CH ₂) ₇ -CHOCH ₂ -(CH ₂) ₇ -		t-C ₄ H ₉	146	β
I-a-10	C ₆ H ₅	OCH ₃	Cl	H	-(CH ₂) ₇ -		t-C ₄ H ₉	204	
I-a-11	C ₆ H ₅	Br	Br	H	CH ₃	CH ₃	t-C ₄ H ₉	*	
I-a-12	C ₆ H ₅	OCH ₃	Cl	H	-(CH ₂) ₇ -CHCH ₂ -(CH ₂) ₇ -		t-C ₄ H ₉	分解	β
I-a-13	C ₆ H ₅	Br	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	t-C ₄ H ₉	150	
I-a-14	C ₆ H ₅	Cl	Br	H	-(CH ₂) ₇ -		t-C ₄ H ₉	234	
I-a-15	C ₆ H ₅	OCH ₃	Cl	H	-(CH ₂) ₇ -		t-C ₄ H ₉	166	
I-a-16	H	CH ₃	H	CH ₃	-(CH ₂) ₇ -CHOCH ₂ -(CH ₂) ₇ -		-C(CH ₃) ₃ , C ₆ H ₅	*	β

[0808]

(I-a-2)

* ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 6.70 (d, 1H), 6.50 (d, 1H), 3.70 (s, 3H), 3.35 (s, 3H), 3.30 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 1.20 (s, 9H) ppm.

[0809]

(I-a-3)

* ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): 7.39 (d, 1H), 7.26 (dd, 1H), 6.88 (d, 1H), 6.72 (s 宽, 1H), 2.47 (m, 2H), 2.15 (s, 3H), 1.82 (m, 4H), 1.65 (信号堆积宽, 3H), 1.19 (s, 9H), 1.11 (t, 3H), 1.05 (m, 1H), 0.96 (d, 3H), 0.95 (m, 1H) ppm.

[0810]

(I-a-4)

* ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): 7.29 (s, 1H), 7.13 (s, 1H), 6.91 (s 宽, 1H), 2.56 (q, 2H), 1.92 (m, 4H), 1.60 (信号堆积宽, 3H), 1.19 (s, 9H), 1.09 (t, 3H), 1.07 (m, 1H), 0.97 (d, 3H), 0.87 (m, 1H) ppm.

[0811]

(I-a-5)

* ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): 7.18 (s, 2H), 6.82 (s 宽, 1H), 3.21 (s, 3H), 3.15 (m, 1H), 2.42 (m, 2H), 2.24 (m, 2H), 2.11 (s, 3H), 1.95 (m, 2H), 1.67 (m, 2H), 1.40 (m, 2H), 1.12 (s, 9H), 1.07 (t, 3H) ppm.

[0812]

(I-a-6)

* ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): 7.01 (s, 1H), 6.98 (s, 2H), 6.72 (s 宽, 1H), 2.46 (m, 2H), 2.15 (s, 3H), 1.82 (m, 4H), 1.65 (信号堆积宽, 3H), 1.18 (s, 9H), 1.09 (t, 3H), 1.05 (m, 1H), 0.96 (d, 3H), 0.7 (m, 1H) ppm.

[0813]

(I-a-7)

* ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): 7.18 (s, 2H), 6.78 (s 宽, 1H), 2.43 (m, 2H), 2.11 (s, 3H), 1.92 (m, 4H), 1.60 (信号堆积宽, 3H), 1.13 (s, 9H), 1.07 (t, 3H), 1.05 (m, 2H), 0.97 (d, 3H) ppm.

[0814]

(I-a-8)

* ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): 7.60 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.00 (sbr, 1H), 2.50 (q, 2H), 2.00-1.50 (m, 8H), 1.50-1.30 (m, 2H), 1.20 (s, 9H), 1.10 (tr, 3H) ppm.

[0815]

(I-a-9)

* ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 6.90 (d, 1H), 6.70 (d, 1H), 3.70 (s, 3H), 3.35 (s, 3H), 3.30 (m, 1H), 2.50 (m, 2H), 1.20 (s, 9H) ppm.

[0816]

(I-a-10)

* ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 6.90 (d, 1H), 6.70 (d, 1H), 3.70 (s, 3H), 2.65 (q, 2H), 2.00-1.30 (m, 10H), 1.30-1.20 (m, 6H) ppm.

[0817]

(I-a-11)

* ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 7.60 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 2.50 (m, 2H), 1.25 (s, 6H), 1.15 (m, 9H) ppm.

[0818]

(I-a-12)

* ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): 6.85 (d, 1H), 6.70 (d, 1H), 3.70 (s, 3H), 2.65 (sept, 1H), 2.50 (dq, 2H), 2.00-1.80 (m, 4H), 1.70-1.40 (m, 5H), 1.175 (d, 3H), 1.150 (d, 3H), 1.10 (tr, 3H), 0.95 (d, 3H) ppm.

[0819]

(I-a-13)

* ^1H -NMR (400 MHz, CDCl_3): 7.30 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 6.55 (sbr, 1H), 2.55 (q, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.50 (s, 3H), 1.45 (s, 3H), 1.20 (tr, 3H), 1.10 (s, 9H) ppm.

[0820]

(I-a-14)

* ^1H -NMR (300 MHz, CDCl_3): 7.40 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 6.95 (sbr, 1H), 2.50 (q, 2H), 2.00-1.60 (m, 8H), 1.50-1.30 (m, 2H), 1.20 (s, 9H), 1.10 (tr, 3H) ppm.

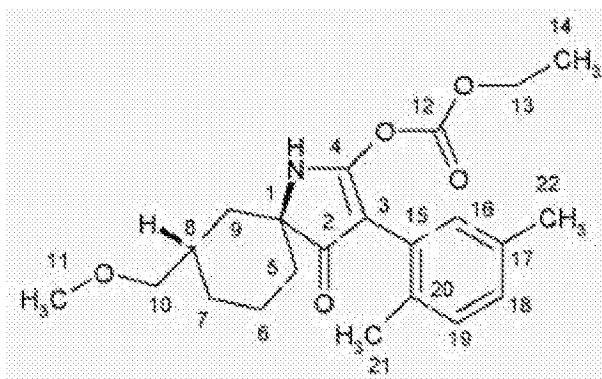
[0821]

(I-a-16)

* ^1H -NMR (400 MHz, d_6 -DMSO): 0.54 (t, 3H), 1.04 (s, 6H), 1.40-1.57 (m, 6H), 1.65-1.72 (m, 2H), 2.05 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 3.21-3.29 (m + s, 1H + 3H), 6.74 (s, 1H), 6.92-6.94 (d, 1H), 7.01-7.03 (d, 1H), 9.05 (sbr, 1H), ppm.

[0822] 实施例 (I-b-1)

[0823]



[0824] 将631 mg (2 mmol) WO 07/048545 的实施例 (I-1-a-6) 的化合物预先加入到 20 ml 二氯甲烷中, 并加入 0.28 ml (2 mmol) 三乙胺。在 20°C, 滴加入在 5 ml 二氯甲烷中的 0.22 ml (2 mmol) 氯甲酸乙酯, 并继续搅拌 1 h。蒸馏除去溶剂并用二氯甲烷/乙酸乙酯在硅胶上色谱分离残余物。

[0825] 收率 0.3 g (理论的31%), 熔点238°C。

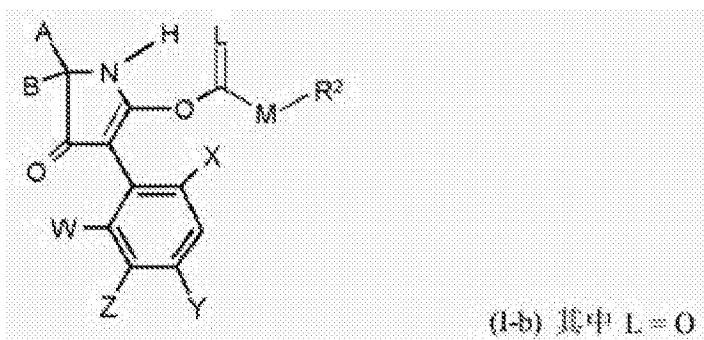
[0826]

^{13}C -NMR (600 MHz, CDCl_3): δ = 14.2 (C-14), 19.7 (C-21), 21.0 (C-22), 22.9 (C-6), 28.9 (C-7), 35.4 (C-5, C-8), 36.9 (C-9), 59.1 (C-11), 67.5 (C-13), 69.1 (C-1), 78.7 (C-10), 100.6 (C-3), 129.2 (C-18), 130.4 (C-15), 130.9 (C-19), 132.0 (C-16), 135.9 (C-17), 136.0 (C-20), 150.5 (C-12), 170.2 (C-4), 200.0 (C-2) ppm.

[0827] 此外分离出 0.2 g (理论的20%) 由 WO 07/048545 的实施例 I-1-c-2 已知的产物。

[0828] 类似于实施例 (I-b-1) 并根据用于制备的通用说明得到下式 (I-b-1) 的化合物

[0829]



[0830]

实施 例 编号	W	X	Y	Z	A	B	M	R ²	熔点 °C	异构体
I-b-2	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₇ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₇ -		O	C ₂ H ₅	*	β
I-b-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CH-(CH ₂) ₂ - CH ₂ OCH ₃		O	C ₂ H ₅	174, *	β
I-b-4	H	CH ₃	Cl	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -CH-(CH ₂) ₂ - CH ₂ OCH ₃		O	C ₂ H ₅	66	β
I-b-5	C ₂ H ₅	<i>o</i> -C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C ₂ H ₅	*	-

[0831]

I-b-2

* ¹H-NMR (400 MHz, CD₃CN): δ = 1.02 (t, 3H, Ar-CH₂CH₃), 1.20 (t, 3H, OCH₂CH₃), 1.29-1.44 (m, 2H), 1.66-1.89 (m, 4H), 2.05 (s, 3H, Ar-CH₃), 2.36-2.45 (m, 2H), 3.25-3.30 (m, 1H, CHOCH₃), 3.32 (s, 3H, OCH₃), 4.16-4.21 (q, 2H, OCH₂CH₃), 7.05 (s, br, 1H, NH), 7.46 (s, 2H, ArH) ppm.

[0832]

I-b-3

* ¹H-NMR (400 MHz, CD₃CN): δ = 1.19 (t, 3H, OCH₂CH₃), 1.21-1.27 ("dt", 2H), 1.61-1.96 (m, 6H), 2.05 (s, 6H, Ar-CH₃), 2.24 (s, 3H, Ar-CH₃), 2.87-2.91 (d, 2H), 3.23-3.25 (d, 2H, CHCH₂O), 3.29 (s, 3H, OCH₃), 6.77 (s, br, 1H, NH), 6.86 (s, 2H, ArH) ppm.

[0833]

(I-b-5)

* ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): 6.90 (d, 1H), 6.70 (d, 1H), 6.36 (s, 宽, 1H), 4.29 (q, 2H), 2.48 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.78 (m, 1H), 1.45 (dd, 6H), 1.32 (t, 3H), 1.11 (dt, 3H), 0.8-0.4 (信号堆积, 4H) ppm.

[0834] 实施例 1

[0835] 猿叶甲(*Phaedon*)-试验(PHAECO 喷雾处理)

[0836] 溶剂: 78.0 重量份丙酮

[0837] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0838] 乳化剂: 0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0839] 为制备合适的活性物质制剂,将1重量份的活性物质与给定量的溶剂和乳化剂混合,并用含乳化剂的水将该浓缩物稀释至所需的浓度。将所需浓度的活性成分制剂喷在大白菜(*Brassica pekinensis*) 圆叶片上,并在干燥后放养辣根猿叶甲(*Phaedon cochleariae*) 的幼虫。

[0840] 7天后,确定以%计的效果。在此,100%意指所有甲虫幼虫均被杀死;0%意指没有甲虫幼虫被杀死。

[0841] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在500克/公顷的施用量的情况下表现出 83%的效果:实施例 I-a-1, I-a-11, I-a-13, I-b-2

[0842] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在500克/公顷的施用量的情况下表现出100%的效果:实施例 I-a-2, I-a-14, I-b-1, I-b-3。

[0843] 实施例 2

[0844] 草地贪夜蛾(*Spodoptera frugiperda*)-试验 (SPODFR 喷雾处理)

[0845] 溶剂: 78.0 重量份丙酮

[0846] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0847] 乳化剂: 0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0848] 为制备合适的活性物质制剂,将1重量份的活性物质与给定量的溶剂和乳化剂混合,并用含乳化剂的水将该浓缩物稀释至所需的浓度。将所需浓度的活性成分制剂喷在玉米(*Zea mays*) 叶的圆叶片上并在干燥后放养草地贪夜蛾(*Spodoptera frugiperda*) 毛虫。

[0849] 7天后,确定以%计的效果。在此,100%意指所有毛虫均被杀死;0%意指没有毛虫被杀死。

[0850] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在500克/公顷的施用量的情况下表现出100%的效果:实施例 I-a-2, I-b-3。

[0851] 实施例 3

[0852] 桃蚜试验(MYZUPE 喷雾处理)

[0853] 溶剂 78 重量份丙酮

[0854] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0855] 乳化剂: 0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0856] 为制备合适的活性物质制剂,将1重量份的活性物质与给定量的溶剂和乳化剂混合,并用含乳化剂的水将该浓缩物稀释至所需的浓度。将所需浓度的活性成分制剂喷在受到所有阶段桃蚜(*Myzus persicae*) 侵染的大白菜(*Brassica pekinensis*) 圆叶片上。

[0857] 5天后,确定以%计的效果。在此,100%意指所有蚜虫均被杀死;0%意指没有蚜虫被杀死。

[0858] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在500克/公顷的施用量的情况下表

现出80%的效果:实施例 I-a-9, I-a-13

[0859] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在500克/公顷的施用量的情况下表现出90%的效果:实施例 I-a-1, I-a-14, I-b-3, I-b-4

[0860] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在500克/公顷的施用量的情况下表现出100%的效果:实施例 I-a-2, I-a-16, I-b-1, I-b-2, I-b-5。

[0861] 实施例 4

[0862] 叶螨(*Tetranychus*) 试验;(TETRUR 喷雾处理)

[0863] 溶剂 78.0 重量份丙酮

[0864] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0865] 乳化剂: 0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0866] 为制备合适的活性物质制剂,将1重量份的活性物质与给定量的溶剂和乳化剂混合,并用含乳化剂的水将该浓缩物稀释至所需的浓度。将所需浓度的活性成分制剂喷在受到所有阶段二点叶螨(*Tetranychus urticae*) 侵扰的菜豆(*Phaseolus vulgaris*) 圆叶片上。

[0867] 5天后,确定以%计的效果。在此,100%意指所有叶螨均被杀死;0%意指没有叶螨被杀死。

[0868] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100克/公顷的施用量的情况下表现出80%的效果:实施例 I-b-2

[0869] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100克/公顷的施用量的情况下表现出90%的效果:实施例 I-b-3

[0870] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100克/公顷的施用量的情况下表现出100%的效果:实施例 I-b-1

[0871] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在500克/公顷的施用量的情况下表现出90%的效果:实施例 I-a-14, I-a-16。

[0872] 实施例 5

[0873] 褐飞虱(*Nilaparvata lugens*)-试验 (NILALU 水培处理)

[0874] 溶剂 78.0 重量份丙酮

[0875] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0876] 乳化剂: 0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0877] 为制备合适的活性物质制剂,将1重量份的活性物质与给定量的溶剂和乳化剂混合,并用含乳化剂的水将该浓缩物稀释至所需的浓度。

[0878] 将该活性物质移取入水中。所给出的浓度指的是活性物质量/体积单位水 (mg/l = ppm),然后用褐飞虱(*Nilaparvata lugens*)感染。

[0879] 7天后,确定以%计的效果。在此,100%意指所有飞虱均被杀死;0%意指没有飞虱被杀死。

[0880] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在20 ppm的施用量的情况下表现出100%的效果:实施例 I-a-13。

[0881] 实施例 6

[0882] 南方根结线虫(*Meloidogyne incognita*)-试验(MELGIN)

[0883] 溶剂:80.0重量份的丙酮

[0884] 为制备合适的活性物质制剂,将1重量份的活性物质与所述量的溶剂混合,并用水将该浓液稀释至所需浓度。

[0885] 用砂、活性物质溶液、南方根结线虫的卵-幼虫-悬浮液和生菜种子填充容器。生菜种子发芽,并且植株生长。在根部形成虫瘿。

[0886] 14天后,借助于虫瘿形成来确定杀线虫作用%。在此,100%意指没有发现虫瘿;0%意指在经处理的植株上的虫瘿数目与未经处理的对照组的虫瘿数目相当。

[0887] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在20ppm的施用量的情况下表现出100%的效果:实施例 I-a-2。

[0888] 实施例 7

[0889] 微小牛蜱(*Boophilus microplus*)-试验 (BOOPMI 注射)

[0890] 溶剂:二甲亚砜

[0891] 为制备合适的活性物质制剂,将10 mg 活性物质与0.5 ml溶剂混合,并且将该浓缩液用溶剂稀释至所需浓度。将活性成分的溶液注射入微小牛蜱(*Boophilus microplus*)的腹部,将这些动物转移到培养皿中并保存在安装空调的室中。活性通过受精卵的产卵来评价。

[0892] 7天后,确定以%计的效果。100%表示没有蜱产任何受精卵。

[0893] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在20 μg / 动物的施用量的情况下表现出80%的效果:实施例 I-a-14

[0894] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在20 μg / 动物的施用量的情况下表现出95%的效果:实施例 I-b-1

[0895] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在20 μg / 动物的施用量的情况下表现出100%的效果:实施例 I-b-3。

[0896] 实施例 8

[0897] 铜绿蝇(*Lucilia cuprina*)-试验(LUCICU)

[0898] 溶剂:二甲亚砜

[0899] 为制备合适的活性物质制剂,将10 mg 活性物质与0.5 ml二甲亚砜混合,并且将该浓缩液用水稀释至所需浓度。将含有用所需浓度的活性成分制剂处理过的马肉的容器放养约20只铜绿蝇(*Lucilia cuprina*)幼虫。

[0900] 2天后,确定以%计的死亡率。在此,100%意指所有幼虫均被杀死;0%意指没有幼虫被杀死。

[0901] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100 ppm的施用量的情况下表现出90%的效果:实施例 I-b-3。

[0902] 实施例 9a

[0903] 1. 芽前除草作用

[0904] 将单子叶和双子叶杂草和作物植物的种子置于木质纤维盆中的砂壤土中,并用泥土覆盖。然后将配制为可湿性粉剂(WP)形式的试验化合物作为水性悬浮液以经换算600升/公顷的水施用率,添加0.2%的润湿剂,以不同的剂量施用至覆盖土壤的表面。

[0905] 在处理,将盆置于温室中,并使之保持在对于试验植株而言良好的生长条件下。

在约3 周的试验期之后,与未处理的对照组比较,对试验植株的发芽损害进行目测评价(以百分比计的除草效果:100%效果=植株死亡,0%效果=类似于对照植株)。

[0906] 在芽前法施用,除了上述化合物之外,以下化合物以320克有效成分 /公顷对大穗看麦娘(*Alopecurus myosuroides*)、马唐草(*Digitaria sanguinalis*)、稗草(*Echinochloa crus-galli*)、多花黑麦草(*Lolium multiflorum*)、狗尾草(*Setaria viridis*)和假高粱(*Sorghum halapense*)表现出 90 - 100% 的效果:I-a-2, I-a-10, I-a-11, I-a-12。

[0907] 在芽前法施用,除了上述化合物之外,以下化合物以320克有效成分 /公顷对大穗看麦娘、稗草、多花黑麦草和狗尾草表现出90 - 100%的效果: I-a-15, I-b-2, I-b-5。

[0908] 2. 芽后除草作用

[0909] 将单子叶和双子叶杂草及作物植物的种子置于木质纤维盆中的砂壤土中,用泥土覆盖,并使之于温室中良好生长条件下栽培。播种后2 至3 周,在单叶期处理所述试验植物。将配制为可湿性粉剂(WP)形式的试验化合物作为水性悬浮液以经换算600 升/ 公顷的水施用率,添加0.2%的润湿剂,以不同的剂量施用至植株绿色部位上。将所述试验植株于温室中在最佳生长条件下保持约3 周之后,相较于未处理对照组对所述制剂的效果进行目测评价(以百分比计的除草效果:100%效果=植株死亡,0%效果=类似于对照植株)。

[0910] 在芽后法施用,除了上述化合物之外,以下化合物以320克有效成分/公顷对大穗看麦娘、野燕麦(*Avena fatua*)、马唐草、稗草、多花黑麦草、狗尾草和假高粱表现出 90 - 100% 的效果:I-a-2, I-a-4, I-a-5, I-a-7, I-a-9, I-a-10, I-a-11, I-a-12, I-a-13, I-a-15。

[0911] 在芽后法施用,除了上述化合物之外,以下化合物以80克有效成分 /公顷对大穗看麦娘、野燕麦(*Avena fatua*)、稗草、多花黑麦草和狗尾草表现出 90 - 100% 的效果:I-a-1, I-b-2。

[0912] 实施例 9b: 对比数据

[0913] 1. 芽前除草作用(之前)

[0914] 将单子叶和双子叶杂草和作物植物的种子置于木质纤维盆中的砂壤土中,并用泥土覆盖。然后将配制为可湿性粉剂(WP)或乳液浓缩剂(EC)形式的试验化合物作为水性悬浮液以经换算600-800 升/ 公顷的水施用率,添加0.1-0.2%的润湿剂,以不同的剂量施用至覆盖土壤的表面。

[0915] 在处理,将盆置于温室中,并使之保持在对于试验植株而言良好的生长条件下。在约3 周的试验期之后,与未处理的对照组比较,对试验植株的发芽损害进行目测评价(以百分比计的除草效果:100%效果=植株死亡,0%效果=类似于对照植株)。

[0916] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物相对于现有技术表现出占优势的效果:见表。

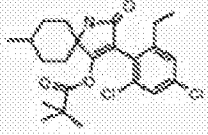
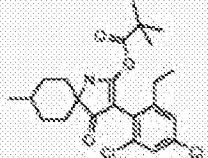
[0917] 2. 芽后除草作用(之后)

[0918] 将单子叶和双子叶杂草及作物植物的种子置于木质纤维盆中的砂壤土中,用泥土覆盖,并使之于温室中良好生长条件下栽培。播种后2 至3 周(根据BBCH 标度阶段10-13),在5-10cm的生长高度时处理所述试验植物。将配制为可湿性粉剂(WP)或乳液浓缩剂(EC)形式的试验化合物作为水性悬浮液以经换算600 -800升/ 公顷的水施用率,添加0.1-

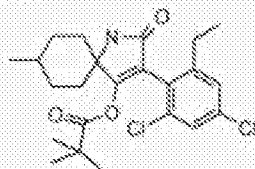
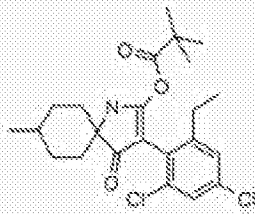
0.2%的润湿剂,以不同的剂量施用至植株绿色部位上。将所述试验植株于温室中在最佳生长条件下保持约3 周之后,相较于未处理对照组对所述制剂的效果进行目测评价(以百分比计的除草效果:100%效果=植株死亡,0%效果=类似于对照植株)。

[0919] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物相对于现有技术表现出占优势的效果:见表

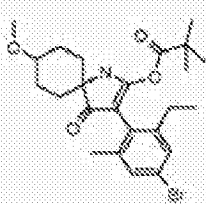
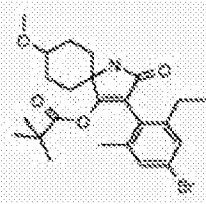
[0920]

活性物质	结构	试验	浓度	% 活性					
				AVEFA	LOLMU	SEIVI	CHEAL	VIOIR	VERPE
I-b-12 由WO 04/065366 已知		之前	320 g/ha	0	40	40	0	0	0
I-a-4 根据本发明		之前	320 g/ha	50	100	90	50	70	40

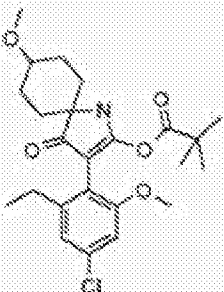
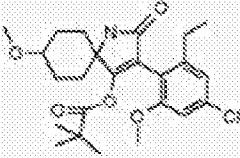
[0921]

活性物质/ 结构	试验	浓度	%活性										
			ORYSA	TRZAS	ZEAMX	ALOMY	AVEFA	DIGSA	ECHCG	LOLMU	SETVI	SORHA	VERPE
I-b-12 由 WO 04/065366 已知 	之后	80 g/ha	0	0	0	0	0	30	40	0	30	0	0
I-a-4 根据本发明 	之后	80 g/ha	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	60

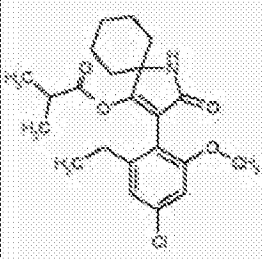
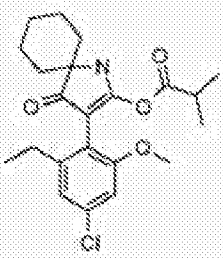
[0922]

活性物质	结构	试验	浓度	% 活性
				ECHCG
I-a-5 根据本发明		之后	20 g/ha	80
I-b-2 由WO 05/006125已知		之后	20 g/ha	50

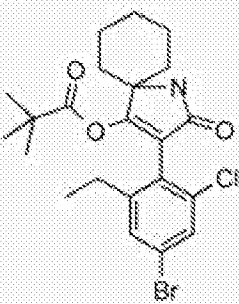
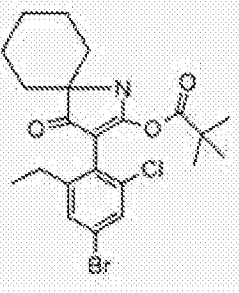
[0923]

活性物质	结构	试验	浓度	% 活性					
				AVESA	LOLMU	SETVI	AMARE	SINAL	STEME
1-a-9 根据本发明		之后	320 g/ha	90	100	100	40	60	40
由WO 04/080962 已知		之后	320 g/ha	0	0	0	0	0	0

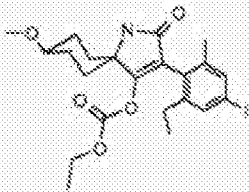
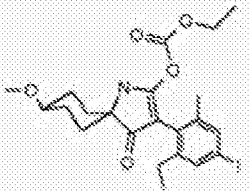
[0924]

活性物质	结构	试验	浓度	% 活性						
				ORYSA	TRZAS	ZEAMX	AVEFA	TRZAS	ALOMY	LOLMU
由 WO 04/08096 已知		之后 之后	80 g/ha	0	0	20	20	0	40	50
			20 g/ha							
1-a-10 根据本发明		之后 之后	80 g/ha	60	90	100	100	80	90	100
			20 g/ha							

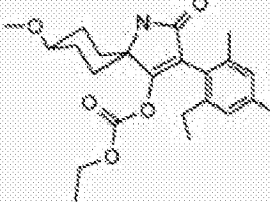
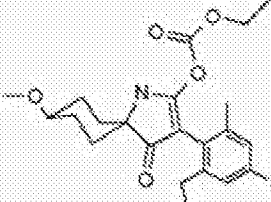
[0925]

活性物质/ 结构	试验	浓度	%活性										
			ORYZA	TRZAS	ZEAMX	ALOMY	AVEFA	DIGSA	ECHCG	LOLMU	SETVI	SORHA	SORHA
I-b-41 由 WO 04/065366 已知 	之后	80 g/ha	0	0	0	0	0	0	80	0	0	0	0
I-a-14 根据本发明 	之后	80 g/ha	80	90	100	80	100	100	100	100	100	100	90

[0926]

				% 活性
活性物质	结构	试验	浓度	SETVI
I-1-c-1 由WO 06/029799已知		之前	20 g/ha	20
I-b-2 根据本发明		之前	20 g/ha	70

[0927]

活性物质	结构	试验	浓度	% 活性		
				ALOMY	DIGSA	ECHCG
I-1-a-1 由WO 06/029799 已知		之后	20 g/ha	30	30	30
I-b-2 根据本发明		之后	20 g/ha	90	90	70

- [0928] AVEFA: 野燕麦
 [0929] LOLMU: 多花黑麦草
 [0930] SETVI: 狗尾草
 [0931] CHEAL: 藜(*Chenopodium album*)
 [0932] VIOTR: 三色堇(*Viola tricolor*)
 [0933] VERPE: 阿拉伯婆婆纳(*Veronica persica*)
 [0934] ORYSA: 稻(*Oryza sativa*)
 [0935] TRZAS: 小麦(*Triticum aestivum*)
 [0936] ZEAMX: 玉米(*Zea mays*)
 [0937] ALOMY: 大穗看麦娘
 [0938] DIGSA: 马唐草
 [0939] ECHCG: 稗草
 [0940] SORHA: 假高粱
 [0941] AVESA: 燕麦(*Avena sativa*)
 [0942] AMARE: 反枝苋(*Amaranthus retroflexus*)
 [0943] SINAL: 白芥子(*Sinapis alba*)
 [0944] STEME: 鹅肠草(*Stellaria media*)。
 [0945] 实施例 10: 对比数据
 [0946] Phaedon 试验(PHAECO 喷雾处理)

[0947] 猿叶甲-试验(PHAECO 喷雾处理)

[0948] 溶剂: 78.0 重量份丙酮

[0949] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0950] 乳化剂: 0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0951] 为制备合适的活性物质制剂,将1重量份的活性物质与给定量的溶剂和乳化剂混合,并用含乳化剂的水将该浓缩物稀释至所需的浓度。

[0952] 将所需浓度的活性成分制剂喷在大白菜(*Brassica pekinensis*) 圆叶片上,并在干燥后放养辣根猿叶甲(*Phaedon cochleariae*) 的幼虫。

[0953] 在希望的时间后,确定以%计的效果。在此,100%意指所有甲虫幼虫均被杀死;0%意指没有甲虫幼虫被杀死。

[0954] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物相对于现有技术表现出占优势的效果:见表。

[0955] 桃蚜试验(MYZUPE 喷雾处理)

[0956] 溶剂 78.0 重量份丙酮

[0957] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0958] 乳化剂: 0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0959] 为制备合适的活性物质制剂,将1重量份的活性物质与给定量的溶剂和乳化剂混合,并用含乳化剂的水将该浓缩物稀释至所需的浓度。

[0960] 将所需浓度的活性成分制剂喷在受到所有阶段桃蚜(*Myzus persicae*) 侵染的大白菜(*Brassica pekinensis*) 圆叶片上。

[0961] 在希望的时间后,确定以%计的效果。在此,100%意指所有蚜虫均被杀死;0%意指没有蚜虫被杀死。

[0962] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物相对于现有技术表现出占优势的效果:见表。

[0963] 叶螨-试验, OP-抗性 (TETRUR 喷雾处理)

[0964] 溶剂 78.0 重量份丙酮

[0965] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0966] 乳化剂: 0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

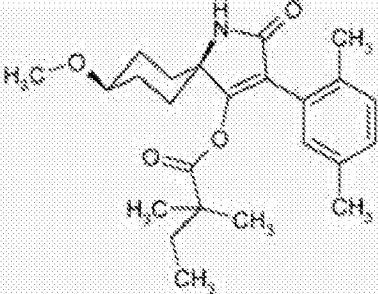
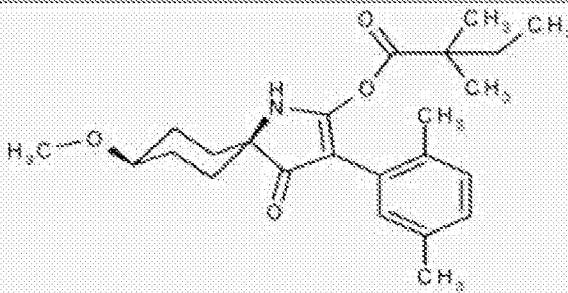
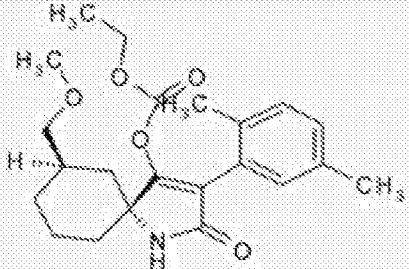
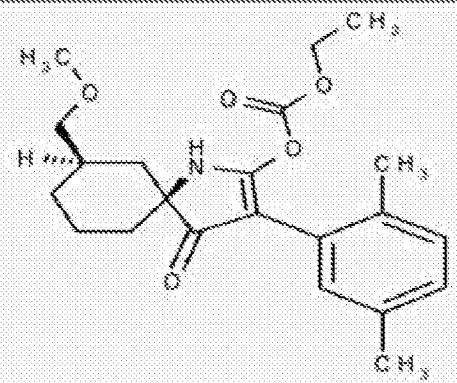
[0967] 为制备合适的活性物质制剂,将1重量份的活性物质与给定量的溶剂和乳化剂混合,并用含乳化剂的水将该浓缩物稀释至所需的浓度。

[0968] 将所需浓度的活性成分制剂喷在受到所有阶段二点叶螨(*Tetranychus urticae*) 侵扰的菜豆(*Phaseolus vulgaris*) 圆叶片上。

[0969] 在希望的时间后,确定以%计的效果。在此,100%意指所有叶螨均被杀死;0%意指没有叶螨被杀死。

[0970] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物相对于现有技术表现出占优势的效果:见表

[0971]

物质	结构	对象	浓度	%活性 dat
由 WO 98/05638 和 WO 04/007448 已知		MYZUPE TETRUR	20 g/ha 500 g/ha	0 5dat 0 5dat
1a-16 根据本发明		MYZUPE TETRUR	20 g/ha 500 g/ha	100 5dat 90 5dat
1-1-e-2 由 WO 07/048545 已知		PHAECO MYZUPE	100 g/ha 4 g/ha	50 7dat 0 5dat
1-b-1 根据本发明		PHAECO MYZUPE	100 g/ha 4 g/ha	100 7dat 90 5dat

[0972] 草地贪夜蛾-试验 (SPODFR 喷雾处理)

[0973] 溶剂: 78.0 重量份丙酮

[0974] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0975] 乳化剂: 0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0976] 为制备合适的活性物质制剂,将1重量份的活性物质与给定量的溶剂和乳化剂混合,并用含乳化剂的水将该浓缩物稀释至所需的浓度。

[0977] 将所需浓度的活性成分制剂喷在玉米(*Zea mays*) 叶的圆叶片上并在干燥后放养草地贪夜蛾(*Spodoptera frugiperda*) 毛虫。

[0978] 在希望的时间后,确定以%计的效果。在此,100%意指所有毛虫均被杀死;0%意指没有毛虫被杀死。

[0979] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物相对于现有技术表现出占优势的效果:见表

[0980] 叶螨-试验, OP-抗性 (TETRUR 喷雾处理)

[0981] 溶剂 78.0 重量份丙酮

[0982] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[0983] 乳化剂: 0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0984] 为制备合适的活性物质制剂,将1重量份的活性物质与给定量的溶剂和乳化剂混合,并用含乳化剂的水将该浓缩物稀释至所需的浓度。

[0985] 将所需浓度的活性成分制剂喷在受到所有阶段二点叶螨(*Tetranychus urticae*)侵扰的菜豆(*Phaseolus vulgaris*)圆叶片上。

[0986] 在希望的时间后,确定以%计的效果。在此,100%意指所有叶螨均被杀死;0%意指没有叶螨被杀死。

[0987] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物相对于现有技术表现出占优势的效果:见表。

[0988] 三叶斑潜蝇(*Liriomyza trifolii*) - 喷射试验 (LIRITR)

[0989] 溶剂 52.5 重量份丙酮

[0990] 7 重量份二甲基甲酰胺

[0991] 乳化剂: 0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0992] 为制备合适的活性物质制剂,将1重量份的活性物质与给定量的溶剂和乳化剂混合,并用含乳化剂的水将该浓缩物稀释至所需的浓度。在需要加入铵盐或/和渗透促进剂时,将它们分别以1000 ppm 的浓度加入制剂溶液中。

[0993] 将所需浓度的活性成分制剂喷在受到斑潜蝇(*Liriomyza trifolii*)幼虫侵袭的菜豆(*Phaseolus vulgaris*)圆叶片上。

[0994] 在希望的时间后,确定以%计的效果。在此,100%意指所有斑潜蝇均被杀死;0%意指没有斑潜蝇被杀死。

[0995] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物相对于现有技术表现出占优势的效果:见表。

[0996] 烟粉虱(*Bemisia tabaci*) -喷射试验 (BEMITA)

[0997] 溶剂 52.5 重量份丙酮

[0998] 7 重量份二甲基甲酰胺

[0999] 乳化剂: 0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[1000] 为制备合适的活性物质制剂,将1重量份的活性物质与给定量的溶剂和乳化剂混合,并用含乳化剂的水将该浓缩物稀释至所需的浓度。

[1001] 将所需浓度的活性成分制剂喷在受到粉虱(*Bemisia tabaci*)幼虫侵袭的棉花(*Gossypium hirsutum*)圆叶片上。

[1002] 在希望的时间后,确定以%计的效果。在此,100%意指所有粉虱均被杀死;0%意指没有粉虱被杀死。

[1003] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物相对于现有技术表现出占优势的效果:见表。

[1004] 桃蚜(Myzus persicae)-试验 (MYZUPE tau)

[1005] 溶剂: 7 重量份二甲基甲酰胺

[1006] 乳化剂: 2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[1007] 为制备合适的活性物质制剂,将1重量份的活性物质与给定量的溶剂和乳化剂混合,并用含乳化剂的水将该浓缩物稀释至所需的浓度。

[1008] 通过浸在所需浓度的活性成分制剂中来处理受到桃蚜(Myzus persicae)严重侵染的大白菜(Brassica pekinensis) 圆叶片。

[1009] 在希望的时间后,确定以%计的死亡率。在此,100%意指所有蚜虫均被杀死;0%意指没有蚜虫被杀死。

[1010] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物相对于现有技术表现出占优势的效果:见表。

[1011] 桃蚜试验; 水培处理 (MYZUPE sys)

[1012] 溶剂: 7 重量份二甲基甲酰胺

[1013] 乳化剂: 2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

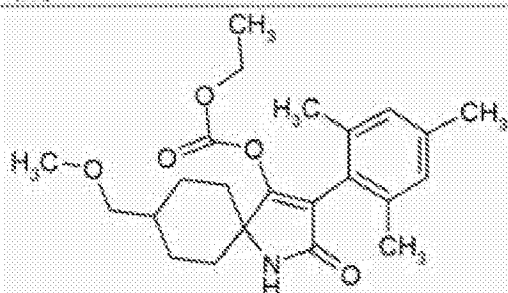
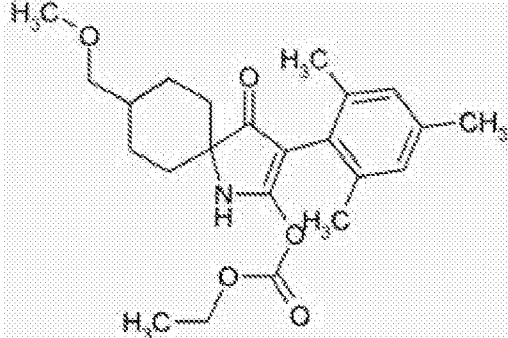
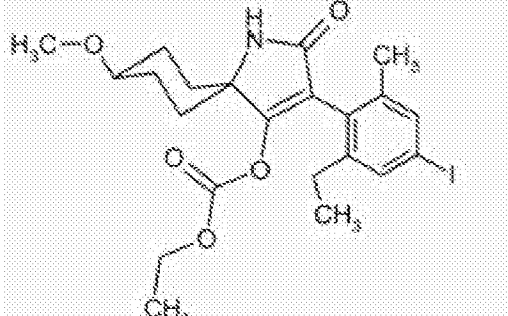
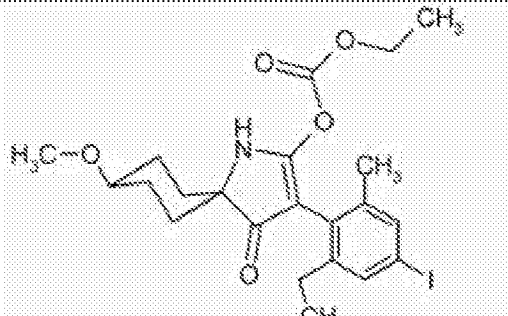
[1014] 为制备合适的活性物质制剂,将1重量份的活性物质与给定量的溶剂和乳化剂混合,并用水将该浓缩物稀释至所需的浓度。

[1015] 将该活性物质制剂与水混合。所给出的浓度是指活性物质的量/体积单位水 (mg/l = ppm)。将所述经处理的水注入具有豌豆植株(Pisum sativum)的容器中,随后用桃蚜(Myzus persicae) 侵染。

[1016] 在希望的时间后,确定以%计的死亡率。在此,100%意指所有蚜虫均被杀死;0%意指没有蚜虫被杀死。

[1017] 在本试验中,例如,以下制备实施例的化合物相对于现有技术表现出占优势的效果:见表

[1018]

物质	结构	对象	浓度	%活性 dat
I-1-c-16 由 WO 07/048545 已知		TETRUR SPODER BENITA LIRITRI	20 g/ha 500 g/ha 20 g/ha 20 g/ha	0 5dat 67 7dat 27 7dat 0 7dat
I-b-3 根据本发明		TETRUR SPODER BENITA LIRITRI	20 g/ha 500 g/ha 20 g/ha 20 g/ha	80 5dat 100 7dat 72 7dat 80 7dat
I-1-c-1 由 WO 06/029799 已知		MYZUPE tau MYZUPE sys	20 ppm 20 ppm	50 6dat 60 6dat
I-b-3 根据本发明		MYZUPE tau MYZUPE sys	20 ppm 20 ppm	90 6dat 99 6dat