



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 101965332 A

(43) 申请公布日 2011. 02. 02

(21) 申请号 200980107590. 5

(22) 申请日 2009. 03. 02

(30) 优先权数据

0804067. 7 2008. 03. 04 GB

(85) PCT申请进入国家阶段日

2010. 09. 03

(86) PCT申请的申请数据

PCT/EP2009/052435 2009. 03. 02

(87) PCT申请的公布数据

W02009/109539 EN 2009. 09. 11

(71) 申请人 先正达参股股份有限公司

地址 瑞士巴塞尔

(72) 发明人 P·梅恩费什 O·许特 P·雷诺

W·赞巴赫 T·皮特纳

(74) 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专
利商标事务所 11038

代理人 李华英

(51) Int. Cl.

C07D 207/48 (2006. 01)

C07D 277/04 (2006. 01)

C07D 277/10 (2006. 01)

C07D 277/22 (2006. 01)

A01N 43/36 (2006. 01)

A01N 43/78 (2006. 01)

A01P 17/00 (2006. 01)

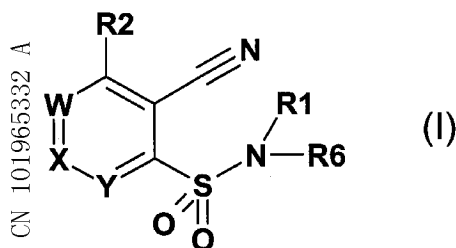
权利要求书 4 页 说明书 49 页

(54) 发明名称

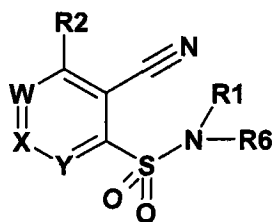
具有农药特性的 2- 氰基苯磺酰胺衍生物

(57) 摘要

式 I 化合物, 其中, 例如 W、X 和 Y 各自是 CH; R¹和 R⁶与相邻氮一起形成 3 至 10- 元饱和环, 其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员, 彼此独立地选自硫、C0、S0、SO₂和 N-R⁷和 / 或该环可以带有 1、2 或 3 个残基, 彼此独立地, 各自选自例如卤素、氰基、硝基、氨基和 C1-C6- 烷基。R²是例如卤素, C1-C6- 烷基, C1-C6- 卤代烷基, C1-C6- 烷氧基, C1-C6- 卤代烷氧基或 C1-C6- 烷氧基 -C1-C6- 烷氧基, 而 R⁷是例如 R¹⁰C(= O), C1-C6 烷基或 C1-C6- 卤代烷基; 和 / 或其盐; 和它们作为农药试剂的用途。



1. 式 I 化合物



其中

W 是 N, NO 或 C-R³;

X 是 N, NO 或 C-R⁴;

Y 是 N, NO 或 C-R⁵;

R¹ 和 R⁶ 与相邻氮一起形成 3 至 10- 元饱和环, 其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有 1、2 或 3 个彼此独立地选自氧、硫、CO、SO、SO₂ 和 N-R⁷ 的杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员, 和 / 或该环可以带有 1、2 或 3 个残基, 彼此独立地, 各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6- 烷基、C1-C6- 卤代烷基、C1-C6- 烷氧基和 C1-C6- 卤代烷氧基,

R² 是 H, 卤素, 氰基, C1-C6- 烷基, C1-C6- 卤代烷基, C1-C6- 烷氧基, C1-C6- 卤代烷氧基, C1-C6- 烷硫基, C1-C6- 烷基亚磺酰基, C1-C6- 烷基磺酰基, C1-C6- 卤代烷硫基, C1-C6- 卤代烷基亚磺酰基, C1-C6- 卤代烷基磺酰基, C2-C6- 烯基, C2-C6- 炔基, C2-C6- 卤代烯基, C2-C6- 卤代炔基, 氨基, (C1-C6- 烷基) 氨基, 二 (C1-C6- 烷基) 氨基, 氨基磺酰基, 氨基亚磺酰基, 氨基硫基, 或 R⁹C(=O); 条件是所述 C1-C6- 烷基, C1-C6- 卤代烷基, C1-C6- 烷氧基, C1-C6- 卤代烷氧基, C1-C6- 烷硫基, C1-C6- 烷基亚磺酰基, C1-C6- 烷基磺酰基, C1-C6- 卤代烷硫基, C1-C6- 卤代烷基亚磺酰基, C1-C6- 卤代烷基磺酰基, C2-C6- 烯基, C2-C6- 炔基, C2-C6- 卤代烯基, C2-C6- 卤代炔基, (C1-C6- 烷基) 氨基, 二 (C1-C6- 烷基) 氨基残基可以是未经取代的, 或者可以带有 1、2 或 3 个残基, 彼此独立地, 各自选自氰基, 硝基, 氨基, OH, C1-C6- 烷基, C1-C6- 卤代烷基, C1-C6- 烷氧基, C1-C6- 烷硫基, C1-C6- 烷基亚磺酰基, C1-C6- 烷基磺酰基, C1-C6- 卤代烷氧基, C1-C6- 卤代烷硫基, (C1-C6- 烷氧基) 羰基, (C1-C6- 烷基) 氨基, 二 (C1-C6- 烷基) 氨基, C3-C8- 环烷基和部分或完全不饱和的环系; 和条件是所述 R⁹C(=O) 残基可以是未经取代的, 或当 R⁹ 是 C1-C6- 烷氧基, (C1-C6- 烷基) 氨基, 二 (C1-C6- 烷基) 氨基, 芳基, 芳基 -C1-C6- 烷基和 C1-C6- 烷基时, 所述烷基部分可以带有一个或多个卤素原子, 或

R⁹ 是 5- 至 6- 元杂芳基, 其中所述杂芳基环含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员, 彼此独立地, 选自氮, 氧, 硫, SO, SO₂ 和 N-Rⁿ, 其中 Rⁿ 是氢或 C1-C6- 烷基, 或

R⁹ 是 3- 至 7- 元杂环基, 其中所述杂环是饱和或部分不饱和的且含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团, 彼此独立地, 选自氮, 氧, 硫, 基团 SO, SO₂ 和 N-R⁸, 其中 R⁸ 是氢或 C1-C6- 烷基, 而其中所述杂环的碳原子可以是未经取代的或由 1 或 2 个彼此独立地选自卤素和 C1-C6- 烷基的残基取代,

R³、R⁴ 和 R⁵ 相互独立地是 H, 卤素, 氰基, 叠氮基, 硝基, C1-C6- 烷基, C3-C8- 环烷基, C1-C6- 卤代烷基, C1-C6- 烷氧基, C1-C6- 卤代烷氧基, C1-C6- 烷硫基, C1-C6- 烷基亚磺酰基, C1-C6- 烷基磺酰基, C1-C6- 卤代烷硫基, C2-C6- 烯基, C2-C6- 炔基, C2-C6- 卤代烯基, C2-C6- 卤代炔基, 氨基, (C1-C6- 烷基) 氨基, 二 (C1-C6- 烷基) 氨基, 氨基磺酰基, 氨基亚

磺酰基,氨基硫基, $R^9C(=O)$, 芳基或杂芳基, 该杂芳基可以含有 1、2 或 3 个彼此独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环成员, 和 / 或该芳基或杂芳基可以带有 1、2 或 3 个取代基, 彼此独立地选自卤素, C1-C6-烷基, C1-C6-卤代烷基, C1-C6-烷氧基和 C1-C6-卤代烷氧基;

条件是如果 W、X 或 Y 之一不是 N, 则 R^1 和 R^6 与相邻氮一起形成 3 至 10-元饱和环, 其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有 1、2 或 3 个彼此独立地选自氧、硫、CO、SO、 SO_2 和 $N-R^7$ 的杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员, 和 / 或该环可以带有 1、2 或 3 个残基, 彼此独立地, 各自选自卤素, 氰基, 硝基, 氨基, C1-C6-烷基, C1-C6-卤代烷基, C1-C6-烷氧基和 C1-C6-卤代烷氧基;

R^7 是氢, $R^{10}C(=O)$, C1-C6-烷基或 C1-C6-卤代烷基;

各 R^9 独立地选自氢, 羟基, C1-C6-烷氧基, 氨基, (C1-C6-烷基) 氨基, 二 (C1-C6-烷基) 氨基, 芳基, 芳基-C1-C6-烷基和 C1-C6-烷基, 其中在所提及的最后两个残基中的所述烷基部分和在芳基或芳基-C1-C6-烷基中的所述芳基部分可以带有一个或多个卤素原子,

5-至 6-元杂芳基, 其中所述杂芳基环含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员, 彼此独立地选自氮、氧、硫、SO、 SO_2 和 $N-R^n$, 其中 R^n 是氢或 C1-C6-烷基, 和

3-至 7-元杂环基, 其中所述杂环是饱和或部分不饱和的且含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团, 彼此独立地选自氮, 氧, 硫, 基团 SO, SO_2 和 $N-R^8$, 其中 R^8 是氢或 C1-C6-烷基, 而其中所述杂环的碳原子可以是未经取代的或由 1 或 2 个彼此独立地选自卤素和 C1-C6-烷基的残基取代; 和

各 R^{10} 独立地是 H, C1-C6-烷基或 C1-C6-卤代烷基;

和 / 或其盐。

2. 根据权利要求 1 的化合物, 其中

W、X 和 Y 各自分别是 $C-R^3$, $C-R^4$ 和 $C-R^5$,

R^1 和 R^6 与相邻氮一起形成 3 至 10-元饱和环, 其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员, 彼此独立地选自氧、硫、CO、SO、 SO_2 和 $N-R^7$ 和 / 或该环可以带有 1、2 或 3 个残基, 彼此独立地各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6-烷基、C1-C6-卤代烷基、C1-C6-烷氧基和 C1-C6-卤代烷氧基; 和

R^7 如权利要求 1 中所定义。

3. 根据权利要求 1 的化合物, 其中

W 是 N, NO 或 $C-R^3$;

X 是 N, NO 或 $C-R^4$;

Y 是 N, NO 或 $C-R^5$;

R^1 和 R^6 与相邻氮一起形成 3 至 10-元饱和环, 其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员, 彼此独立地选自硫、CO、SO、 SO_2 和 $N-R^7$ 和 / 或该环可以带有 1、2 或 3 个残基, 彼此独立地各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6-烷基、C1-C6-卤代烷基、C1-C6-烷氧基和 C1-C6-卤代烷氧基; 和

R^7 如权利要求 1 中所定义。

4. 根据权利要求 1 或权利要求 3 的化合物, 其中 W 和 Y 是 CH 而 X 是 CH 或 N。

5. 根据权利要求 1 至 4 中任一项的化合物, 其中 R^2 是卤素, C1-C6-烷基, C1-C6-卤代烷基, C1-C6-烷氧基, C1-C6-卤代烷氧基或 C1-C6-烷氧基-C1-C6-烷氧基。

6. 根据权利要求5的化合物,其中 R^2 是卤素,C1-C6-烷基,C1-C6-卤代烷基,C1-C6-烷氧基或C1-C6-卤代烷氧基。

7. 根据权利要求1、2和4-6中任一项的化合物,其中W、X和Y各自是CH, R^2 选自卤素,C1-C6-烷基,C1-C6-卤代烷基,C1-C6-烷氧基和C1-C6-卤代烷氧基,而 R^1 和 R^6 与相邻氮一起形成3至10-元饱和环,其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有1、2或3个杂原子和/或杂原子基团作为环成员,彼此独立地选自氧、硫、CO、SO、SO₂和N- R^7 和/或该环可以带有1、2或3个残基,彼此独立地各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6-烷基、C1-C6-卤代烷基、C1-C6-烷氧基和C1-C6-卤代烷氧基;和

R^7 如权利要求1中所定义。

8. 根据权利要求1、3和4-6中任一项的化合物,其中W和Y各自是CH,X是N, R^2 选自卤素,C1-C6-烷基,C1-C6-卤代烷基,C1-C6-烷氧基和C1-C6-卤代烷氧基,而 R^1 和 R^6 与相邻氮一起形成3至10-元饱和环,其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有1、2或3个杂原子和/或杂原子基团作为环成员,彼此独立地选自硫、CO、SO、SO₂和N- R^7 和/或该环可以带有1、2或3个残基,彼此独立地各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6-烷基、C1-C6-卤代烷基、C1-C6-烷氧基和C1-C6-卤代烷氧基;和

R^7 如权利要求1中所定义。

9. 根据权利要求1、3和4-6中任一项的化合物,其中W和Y各自是CH,X是N, R^2 是C1-C6-烷氧基,而 R^1 和 R^6 与相邻氮一起形成3至10-元饱和环,其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有1、2或3个杂原子和/或杂原子基团作为环成员,彼此独立地选自硫、CO、SO、SO₂和N- R^7 和/或该环可以带有1、2或3个残基,彼此独立地各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6-烷基、C1-C6-卤代烷基、C1-C6-烷氧基和C1-C6-卤代烷氧基;和

R^7 如权利要求1中所定义。

10. 根据权利要求1至9中任一项的化合物,其中 R^1 和 R^6 与相邻氮一起形成3至10-元环,其中该环除了所述氮和碳环成员之外还含有硫原子或选自CO、SO和SO₂的基团,并且该环可以带有1、2或3个残基,彼此独立地各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6-烷基、C1-C6-卤代烷基、C1-C6-烷氧基和C1-C6-卤代烷氧基。

11. 根据权利要求10的化合物,其中 R^1 和 R^6 与相邻氮一起形成5元环,该环除了所述氮和碳环成员之外还含有硫原子或选自CO、SO和SO₂的基团。

12. 根据权利要求11的化合物,其中 R^1 和 R^6 与所述相邻氮一起是噻唑烷基。

13. 一种组合物,其包含如权利要求1至12中任一项所定义的式I化合物和一种或多种常规配制剂辅剂。

14. 一种组合物,其包含如权利要求1至12任一项中所定义的式I化合物,和一种或多种活性成分,以及任选地包含一种或多种常规配制剂辅剂。

15. 在植物保护中防治病虫害或者保护种子、植物、在之后的时间点生长的植物器官和/或植物部分对抗病虫害损害的方法,其包括将如权利要求1至12中任一项所定义的式I化合物或其组合物施用至所述病虫害,至所述植物,至所述种子,至所述植物部分和/或植物器官和/或其各自的环境。

16. 包含如权利要求1至12中任一项所定义的式I化合物的种子。

17. 防治病虫害的方法,其包括将如权利要求1至12中任一项所定义的化合物施用至

所述病虫害、要保护的材料和 / 或其环境。

18. 根据权利要求 17 的方法,其中所述材料选自原材料,比如木材、织物、地板覆盖物和建筑材料。

19. 根据权利要求 17 的方法,其中防治所述病虫害以避免损害贮藏物品。

20. 根据权利要求 17 的方法,其中在卫生领域,特别是人类、家畜和农用牲畜的保护中防治所述病虫害。

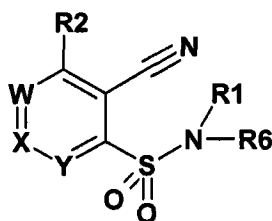
具有农药特性的 2- 氰基苯磺酰胺衍生物

[0001] 本发明涉及某些邻位-经取代的氰基(杂)芳基磺酰基化合物,及其盐,其组合物和经处理的材料,以及使用所述化合物和盐的方法。

[0002] EP33984, W02005035486, W02006056433, W02006100271, W02006100288, W02007060220, W02007014913 公开具有农药活性的氰基苯或氰基吡啶衍生物。

[0003] 目前发现某些氰基(杂)芳基磺酰基化合物具有农药特性。因此,在第一方面,本发明涉及所述式 I 化合物

[0004]



[0005] 其中

[0006] W 是 N, NO 或 C-R³;

[0007] X 是 N, NO 或 C-R⁴;

[0008] Y 是 N, NO 或 C-R⁵;

[0009] R¹ 和 R⁶ 与相邻氮一起形成 3 至 10- 元饱和环,其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有 1、2 或 3 个彼此独立地选自氧、硫、CO、SO、SO₂ 和 N-R⁷ 的杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员,和 / 或该环可以带有 1、2 或 3 个残基,彼此独立地,各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6- 烷基、C1-C6- 卤代烷基、C1-C6- 烷氧基和 C1-C6- 卤代烷氧基,

[0010] R² 是 H, 卤素, 氰基, C1-C6- 烷基, C1-C6- 卤代烷基, C1-C6- 烷氧基, C1-C6- 卤代烷氧基, C1-C6- 烷硫基, C1-C6- 烷基亚磺酰基, C1-C6- 烷基磺酰基, C1-C6- 卤代烷硫基, C1-C6- 卤代烷基亚磺酰基, C1-C6- 卤代烷基磺酰基, C2-C6- 烯基, C2-C6- 炔基, C2-C6- 卤代烯基, C2-C6- 卤代炔基, 氨基, (C1-C6- 烷基) 氨基, 二 (C1-C6- 烷基) 氨基, 氨基磺酰基, 氨基亚磺酰基, 氨基硫基 (aminosulphenyl), 或 R⁹C(=O); 条件是所述 C1-C6- 烷基, C1-C6- 卤代烷基, C1-C6- 烷氧基, C1-C6- 卤代烷氧基, C1-C6- 烷硫基, C1-C6- 烷基亚磺酰基, C1-C6- 烷基磺酰基, C1-C6- 卤代烷硫基, C1-C6- 卤代烷基亚磺酰基, C1-C6- 卤代烷基磺酰基, C2-C6- 烯基, C2-C6- 炔基, C2-C6- 卤代烯基, C2-C6- 卤代炔基, (C1-C6- 烷基) 氨基, 二 (C1-C6- 烷基) 氨基残基可以是未经取代的, 或者可以带有 1、2 或 3 个残基, 彼此独立地, 各自选自氰基, 硝基, 氨基, OH, C1-C6- 烷基, C1-C6- 卤代烷基, C1-C6- 烷氧基, C1-C6- 烷硫基, C1-C6- 烷基亚磺酰基, C1-C6- 烷基磺酰基, C1-C6- 卤代烷氧基, C1-C6- 卤代烷硫基, (C1-C6- 烷氧基) 羰基, (C1-C6- 烷基) 氨基, 二 (C1-C6- 烷基) 氨基, C3-C8- 环烷基和部分或完全不饱和的环系; 和条件是所述 R⁹C(=O) 残基可以是未经取代的, 或当 R⁹ 是 C1-C6- 烷氧基, (C1-C6- 烷基) 氨基, 二 (C1-C6- 烷基) 氨基, 芳基, 芳基 -C1-C6- 烷基和 C1-C6- 烷基时, 所述烷基部分可以带有一个或多个卤素原子, 或

[0011] R⁹ 是 5- 至 6- 元杂芳基, 其中所述杂芳基环含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子

基团作为环成员,彼此独立地,选自氮,氧,硫, SO , SO_2 和 N-R^n , 其中 R^n 是氢或 C1-C6- 烷基, 或

[0012] R^9 是 3- 至 7- 元杂环基, 其中所述杂环是饱和或部分不饱和的且含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团, 彼此独立地, 选自氮, 氧, 硫, 基团 SO , SO_2 和 N-R^8 , 其中 R^8 是氢或 C1-C6- 烷基, 而其中所述杂环的碳原子可以是未经取代的或由 1 或 2 个彼此独立地选自卤素和 C1-C6- 烷基的残基取代。

[0013] R^3 、 R^4 和 R^5 相互独立地是 H, 卤素, 氰基, 叠氮基, 硝基, C1-C6- 烷基, C3-C8- 环烷基, C1-C6- 卤代烷基, C1-C6- 烷氧基, C1-C6- 卤代烷氧基, C1-C6- 烷基亚磺酰基, C1-C6- 烷基磺酰基, C1-C6- 卤代烷硫基, C2-C6- 烯基, C2-C6- 炔基, C2-C6- 卤代烯基, C2-C6- 卤代炔基, 氨基, (C1-C6- 烷基) 氨基, 二 (C1-C6- 烷基) 氨基, 氨基磺酰基, 氨基亚磺酰基, 氨基硫基, $\text{R}^9\text{C}(=\text{O})$, 芳基或杂芳基, 该杂芳基可以含有 1、2 或 3 个彼此独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环成员和 / 或该芳基或杂芳基可以带有 1、2 或 3 个取代基, 彼此独立地选自卤素, C1-C6- 烷基, C1-C6- 卤代烷基, C1-C6- 烷氧基和 C1-C6- 卤代烷氧基;

[0014] 条件是如果 W、X 或 Y 之一不是 N, 则 R^1 和 R^6 与相邻氮一起形成 3 至 10- 元饱和环, 其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有 1、2 或 3 个彼此独立地选自氧、硫、CO、 SO 、 SO_2 和 N-R^7 的杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员, 和 / 或该环可以带有 1、2 或 3 个残基, 彼此独立地, 各自选自卤素, 氰基, 硝基, 氨基, C1-C6- 烷基, C1-C6- 卤代烷基, C1-C6- 烷氧基和 C1-C6- 卤代烷氧基;

[0015] R^7 是氢, $\text{R}^{10}\text{C}(=\text{O})$, C1-C6 烷基或 C1-C6- 卤代烷基;

[0016] 各 R^9 独立地选自氢, 羟基, C1-C6- 烷氧基, 氨基, (C1-C6- 烷基) 氨基, 二 (C1-C6- 烷基) 氨基, 芳基, 芳基 -C1-C6- 烷基和 C1-C6- 烷基, 其中在所提及的最后两个残基中的所述烷基部分和在芳基或芳基 -C1-C6- 烷基中的所述芳基部分可以带有一个或多个卤素原子,

[0017] 5- 至 6- 元杂芳基, 其中所述杂芳基环含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员, 彼此独立地选自氮、氧、硫、 SO 、 SO_2 和 N-R^n , 其中 R^n 是氢或 C1-C6- 烷基, 和

[0018] 3- 至 7- 元杂环基, 其中所述杂环是饱和或部分不饱和的且含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团, 彼此独立地选自氮, 氧, 硫, 基团 SO , SO_2 和 N-R^8 , 其中 R^8 是氢或 C1-C6- 烷基, 而其中所述杂环的碳原子可以是未经取代的或由 1 或 2 个彼此独立地选自卤素和 C1-C6- 烷基的残基取代; 和

[0019] 各 R^{10} 独立地是 H, C1-C6- 烷基或 C1-C6- 卤代烷基;

[0020] 和 / 或其盐。

[0021] 所述式 (I) 化合物可以以不同的几何或旋光异构体或者互变异构形式存在。本发明涵盖全部比例的全部这些异构体和互变异构体及其混合物。特别地, 在式 I 化合物具有一个或多个手性中心的情况下, 它们可以作为对映异构体或非对映异构体的混合物存在。本发明提供纯对映异构体或非对映异构体或者其各自的混合物, 以及同位素形式比如氘化的化合物。

[0022] 在各变量的上述定义中所提及的有机部分是单个基团成员的单独列表的集合术语。前缀 Cn-Cm 在各情况下是指基团中碳原子的可能个数。类似地, 术语“x 至 y 元”是指在相应环中形成闭合链的原子的可能个数。

[0023] 术语卤素在各情况下表示氟,溴,氯或碘。

[0024] 措辞“可以带有一个或多个卤素原子”指所述残基中的一个或多个带有一个或多个卤素原子;在两个或多个卤素原子的情况下,所述原子可以是不同的,但优选所述卤素原子是相同的。因此,取决于其位置和在所述残基中的取代程度一个碳原子还能够带有多至三个卤素原子。

[0025] 术语“C1-C6-烷基”如本文所用指饱和直链或分支的烃残基,其经由所述碳原子中任一个来连接且具有1至6个碳原子,例如任意下述残基:1-甲基丁基,2-甲基丁基,3-甲基丁基,2,2-二甲基丙基,1-乙基丙基,正己基,正戊基,1,1-二甲基丙基,1,2-二甲基丙基,1-甲基戊基,2-甲基戊基,3-甲基戊基,4-甲基戊基,1,1-二甲基丁基,1,2-二甲基丁基,1,3-二甲基丁基,2,2-二甲基丁基,2,3-二甲基丁基,3,3-二甲基丁基,1-乙基丁基,2-乙基丁基,1,1,2-三甲基丙基,1,2,2-三甲基丙基,1-乙基-1-甲基丙基,或1-乙基-2-甲基丙基。

[0026] 术语“C1-C6-卤代烷基”如本文所用指直链或分支的饱和烷基残基,其经由所述碳原子中任一个来连接且具有1至6个碳原子(如上所述),其中在这些残基中的一些或全部氢原子可以由氟、氯、溴和/或碘替代,也即例如任意下述基团:氯甲基,二氯甲基,三氯甲基,氟甲基,二氟甲基,三氟甲基,氯氟甲基,二氯氟甲基,氯二氟甲基,2-氟乙基,2-氯乙基,2-溴乙基,2-碘乙基,2,2-二氟乙基,2,2,2-三氟乙基,2-氯-2-氟乙基,2-氯-2,2-二氟乙基,2,2-二氯-2-氟乙基,2,2,2-三氯乙基,五氟乙基,2-氟丙基,3-氟丙基,2,2-二氟丙基,2,3-二氟丙基,2-氯丙基,3-氯丙基,2,3-二氯丙基,2-溴丙基,3-溴丙基,3,3,3-三氟丙基,3,3,3-三氯丙基,2,2,3,3,3-五氟丙基,七氟丙基,1-(氟甲基)-2-氟乙基,1-(氯甲基)-2-氯乙基,1-(溴甲基)-2-溴乙基,4-氟丁基,4-氯丁基,4-溴丁基或九氟丁基。因此,术语“C1-C2-氟烷基”将指带有1、2、3、4、或5个氟原子的C1-C2-烷基残基,例如任意下述基团:二氟甲基,三氟甲基,1-氟乙基,2-氟乙基,2,2-二氟乙基,2,2,2-三氟乙基,1,1,2,2-四氟乙基或五氟乙基。

[0027] 术语“C1-C6-烷氧基”如本文所用指具有1至6个碳原子的直链或分支的饱和烷基残基(如上所述),其经由氧原子来连接,也即例如任意下述基团:甲氧基,乙氧基,正丙氧基,1-甲基乙氧基,正丁氧基,1-甲基丙氧基,2-甲基丙氧基或1,1-二甲基乙氧基。类似地,术语“烯氧基”、“炔氧基”和“苄氧基”分别指相应的经由氧原子来连接的烯基、炔基和苄基残基。

[0028] 术语“C1-C6-卤代烷氧基”如本文所用指如上所述的C1-C6-烷氧基残基,其部分或完全由氟、氯、溴和/或碘取代,也即例如任意下述基团:氯甲氧基,二氯甲氧基,三氯甲氧基,氟甲氧基,二氟甲氧基,三氟甲氧基,氯氟甲氧基,二氯氟甲氧基,氯二氟甲氧基,2-氟乙氧基,2-氯乙氧基,2-溴乙氧基,2-碘乙氧基,2,2-二氟乙氧基,2,2,2-三氟乙氧基,2-氯-2-氟乙氧基,2-氯-2,2-二氟乙氧基,2,2-二氯-2-氟乙氧基,2,2,2-三氯乙氧基,五氟乙氧基,2-氟丙氧基,3-氟丙氧基,2,2-二氟丙氧基,2,3-二氟丙氧基,2-氯丙氧基,3-氯丙氧基,2,3-二氯丙氧基,2-溴丙氧基,3-溴丙氧基,3,3,3-三氟丙氧基,3,3,3-三氯丙氧基,2,2,3,3,3-五氟丙氧基,七氟丙氧基,1-(氟甲基)-2-氟乙氧基,1-(氯甲基)-2-氯乙氧基,1-(溴甲基)-2-溴乙氧基,4-氟丁氧基,4-氯丁氧基,4-溴丁氧基或九氟丁氧基。

[0029] 术语“(C3-C8-环烷基)硫基”如本文所用指具有3至8个碳原子的经由硫原子来连接的单环烃残基,例如,2-环戊硫基,2-环戊硫基或3-环丁硫基。这种残基也称为(C-C8-环烷基)硫基。

[0030] 术语“C1-C6-烷基硫基”(或C1-C6-烷基硫基:C1-C6-烷基-S-)如本文所用指具有1至6个碳原子的直链或分支的饱和烷基残基(如上所述),其经由硫原子来连接,也即例如任意下述基团:甲硫基,乙硫基,正丙硫基,1-甲基乙硫基,丁硫基,1-甲基丙硫基,2-甲基丙硫基或1,1-二甲基乙硫基。

[0031] 术语“C1-C6-烷基亚磺酰基”(或C1-C6-烷基-S(=O)-)如本文所用指具有1至6个碳原子的直链或分支的饱和烷基残基(如上所述),其经由所述亚磺酰基的硫原子来连接,也即例如任意下述基团:CH₃-SO, C₂H₅-SO, 正丙基亚磺酰基,1-甲基乙基-亚磺酰基,正丁基亚磺酰基,1-甲基丙基亚磺酰基,2-甲基丙基亚磺酰基,1,1-二甲基-乙基亚磺酰基,正戊基亚磺酰基,1-甲基丁基亚磺酰基,2-甲基丁基亚磺酰基,3-甲基-丁基亚磺酰基,1,1-二甲基丙基亚磺酰基,1,2-二甲基丙基亚磺酰基,2,2-二甲基丙基亚磺酰基或1-乙基丙基亚磺酰基。

[0032] 术语“C1-C6-烷基磺酰基”(或C1-C6-烷基-S(=O)₂-)如本文所用指具有1至6个碳原子的直链或分支的饱和烷基残基(如上所述),其经由所述磺酰基的硫原子来连接,也即例如任意下述基团:CH₃-SO₂, C₂H₅-SO₂, 正丙基磺酰基, (CH₃)₂CH-SO₂, 正丁基磺酰基,1-甲基丙基磺酰基,2-甲基丙基磺酰基或(CH₃)₃C-SO₂。术语“C1-C6-卤代烷基硫基”如本文所用指如上所述的C1-C6-烷基硫基残基,其部分或完全由氟、氯、溴和/或碘取代,也即例如任意下述基团:氟甲硫基,二氟甲硫基,三氟甲硫基,氯二氟甲硫基,溴二氟甲硫基,2-氟乙硫基,2-氯乙硫基,2-溴乙硫基,2-碘乙硫基,2,2-二氟乙硫基,2,2,2-三氟乙硫基,2,2,2-三氯乙硫基,2-氯-2-氟乙硫基,2-氯-2,2-二氟乙硫基,2,2-二氯-2-氟乙硫基,五氟乙硫基,2-氟丙硫基,3-氟丙硫基,2-氯丙硫基,3-氯丙硫基,2-溴丙硫基,3-溴丙硫基,2,2-二氟丙硫基,2,3-二氟丙硫基,2,3-二氯丙硫基,3,3,3-三氟丙硫基,3,3,3-三氯丙硫基,2,2,3,3,3-五氟丙硫基,七氟丙硫基,1-(氟甲基)-2-氟乙硫基,1-(氯甲基)-2-氯乙硫基,1-(溴甲基)-2-溴乙硫基,4-氟丁硫基,4-氯丁硫基,4-溴丁硫基或九氟丁硫基。

[0033] 术语“C1-C6-烷氧羰基”如本文所用指具有1至6个碳原子的直链或分支的烷氧基残基(如上所述),其经由所述羰基的碳原子来连接,也即例如任意下述基团:甲氧羰基,乙氧羰基,正丙氧羰基,1-甲基乙氧羰基,正丁氧羰基,1-甲基丙氧羰基,2-甲基丙氧羰基或1,1-二甲基乙氧羰基。

[0034] 术语“C2-C6-烯基”如本文所用指直链或分支的单-不饱和的烃残基,其经由所述碳原子中任一个来连接且具有2至6个碳原子和任意位置的双键,也即例如任意下述基团:乙烯基,1-丙烯基,2-丙烯基,1-甲基-乙烯基,1-丁烯基,2-丁烯基,3-丁烯基,1-甲基-1-丙烯基,2-甲基-1-丙烯基,1-甲基-2-丙烯基,2-甲基-2-丙烯基,1-戊烯基,2-戊烯基,3-戊烯基,4-戊烯基,1-甲基-1-丁烯基,2-甲基-1-丁烯基,3-甲基-1-丁烯基,1-甲基-2-丁烯基,2-甲基-2-丁烯基,3-甲基-2-丁烯基,1-甲基-3-丁烯基,2-甲基-3-丁烯基,3-甲基-3-丁烯基,1,1-二甲基-2-丙烯基,1,2-二甲基-1-丙烯基,1,2-2-甲基-2-丙烯基,1-乙基-1-丙烯基,1-乙基-2-丙烯基,1-己烯基,2-己烯基,3-己烯基,

4-己烯基,5-己烯基,1-甲基-1-戊烯基,2-甲基-1-戊烯基,3-甲基-1-戊烯基,4-甲基-1-戊烯基,1-甲基-2-戊烯基,2-甲基-2-戊烯基,3-甲基-2-戊烯基,4-甲基-2-戊烯基,1-甲基-3-戊烯基,2-甲基-3-戊烯基,3-甲基-3-戊烯基,4-甲基-3-戊烯基,1-甲基-4-戊烯基,2-甲基-4-戊烯基,3-甲基-4-戊烯基,4-甲基-4-戊烯基,1,1-二甲基-2-丁烯基,1,1-二甲基-3-丁烯基,1,2-二甲基-1-丁烯基,1,2-二甲基-2-丁烯基,1,2-二甲基-3-丁烯基,1,3-二甲基-1-丁烯基,1,3-二甲基-2-丁烯基,1,3-二甲基-3-丁烯基,2,2-二甲基-3-丁烯基,2,3-二甲基-1-丁烯基,2,3-二甲基-2-丁烯基,2,3-二甲基-3-丁烯基,3,3-二甲基-1-丁烯基,3,3-二甲基-2-丁烯基,1-乙基-1-丁烯基,1-乙基-2-丁烯基,1-乙基-3-丁烯基,2-乙基-1-丁烯基,2-乙基-2-丁烯基,2-乙基-3-丁烯基,1,1,2-三甲基-2-丙烯基,1-乙基-1-甲基-2-丙烯基,1-乙基-2-甲基-1-丙烯基或1-乙基-2-甲基-2-丙烯基。

[0035] 术语“C2-C6-炔基”如本文所用指经由所述碳原子中任一个来连接的直链或分支的脂族烃残基,其含有C-C三键且具有2至6个碳原子,例如任意下述基团:乙炔基,丙-1-炔-1-基,丙-2-炔-1-基,正丁-1-炔-1-基,正丁-1-炔-3-基,正丁-1-炔-4-基,正丁-2-炔-1-基,正戊-1-炔-1-基,正戊-1-炔-3-基,正戊-1-炔-4-基,正戊-1-炔-5-基,正戊-2-炔-1-基,正戊-2-炔-4-基,正戊-2-炔-5-基,3-甲基丁-1-炔-3-基,3-甲基丁-1-炔-4-基,正己-1-炔-1-基,正己-1-炔-3-基,正己-1-炔-4-基,正己-1-炔-5-基,正己-1-炔-6-基,正己-2-炔-1-基,正己-2-炔-4-基,正己-2-炔-5-基,正己-2-炔-6-基,正己-3-炔-1-基,正己-3-炔-2-基,3-甲基戊-1-炔-1-基,3-甲基戊-1-炔-3-基,3-甲基戊-1-炔-4-基,3-甲基戊-1-炔-5-基,4-甲基戊-1-炔-1-基,4-甲基戊-2-炔-4-基或4-甲基戊-2-炔-5-基等。

[0036] 术语“C3-C8-环烷基”如本文所用指具有3至8个碳原子的单环烃残基,例如任意下述基团:环丙基,环丁基,环戊基,环己基,环庚基或环辛基。

[0037] 术语“(C1-C6-烷基)氨基”如本文所用指具有1至6个碳原子的直链或分支的饱和烷基残基(如上所述),其经由所述氨基的氮原子来连接,也即例如任意下述基团:甲基氨基,乙基氨基,正丙基氨基,1-甲基乙基氨基,正丁基氨基,1-甲基丙基氨基,2-甲基丙基氨基或1,2-二甲基乙基氨基。

[0038] 术语“二(C1-C6-烷基)氨基”如本文所用指具有1至6个碳原子的两个直链或分支的饱和烷基残基(如上所述),其各自经由所述氨基的氮原子来连接,例如任意下述基团:N,N-二甲基氨基,N,N-二乙基氨基,N,N-二(1-甲基乙基)氨基,N,N-二丙基氨基,N,N-二丁基氨基,N,N-二-(1-甲基丙基)氨基,N,N-二-(2-甲基丙基)氨基,N,N-二-(1,1-二甲基乙基)氨基,N-乙基-N-甲基氨基,N-甲基-N-丙基氨基,N-甲基-N-(1-甲基乙基)氨基,N-丁基-N-甲基氨基,N-甲基-N-(1-甲基丙基)-氨基,N-甲基-N-(2-甲基丙基)氨基,N-(1,1-二甲基乙基)-N-甲基氨基,N-乙基-N-丙基氨基,N-乙基-N-(1-甲基乙基)氨基,N-丁基-N-乙基氨基,N-乙基-N-(1-甲基丙基)氨基,N-乙基-N-(2-甲基丙基)氨基,N-乙基-N-(1,1-二甲基-乙基)氨基,N-(1-甲基乙基)-N-丙基氨基,N-丁基-N-丙基氨基,N-(1-甲基-丙基)-N-丙基氨基,N-(2-甲基丙基)-N-丙基氨基,N-(1,1-二甲基乙基)-N-丙基氨基,N-丁基-N-(1-甲基乙基)氨基,N-(1-甲基乙基)-N-(1-甲

基丙基)-氨基,N-(1-甲基乙基)-N-(2-甲基丙基)氨基,N-(1,1-二甲基乙基)-N-(1-甲基-乙基)氨基,N-丁基-N-(1-甲基丙基)氨基,N-丁基-N-(2-甲基丙基)氨基,N-丁基-N-(1,1-二甲基乙基)氨基,N-(1-甲基丙基)-N-(2-甲基丙基)氨基,N-(1,1-二甲基乙基)-N-(1-甲基丙基)氨基或N-(1,1-二甲基乙基)-N-(2-甲基丙基)-氨基。

[0039] 术语“环”如本文所用指具有形成闭合链的原子组的残基或取代基,所述环可以是饱和、或部分或完全不饱和的。所述环可以仅含有碳原子或可以含有碳原子以及一个或多个选自氧、硫和氮原子的杂原子。实例是环烷基,饱和或部分饱和的杂环基,芳基,杂芳基。

[0040] 术语“环系”如本文所用指具有一个或多个环的残基或取代基,各环可以相互独立地是饱和或部分或完全不饱和的,和/或在所述环系中的一个或多个环可以在所述闭合链中含有一个或多个杂原子和/或杂原子基团和/或所述环可以被取代。所述环可以直接结合(或连接)至化合物的其余部分或者经由联接基团比如C1-C6-亚烷基来结合(或连接),所述基团可以是未经取代的,用卤素和/或C1-C6-烷基取代,和/或所述联接基团可以含有至少一个选自N、O、S、SO、SO₂和C(=O)的杂原子和/或杂原子基团。在两个或多个环的情况下,两个环可以是稠合的,桥连的(比如降莰烷(norbornane)),螺环连接的,或者通过桥联基(例如C1-C2-亚烷基)、原子(比如硫或氧)或键相连。在所述部分或完全不饱和的环系的情况下,不饱和度指整个环系而不是环系中的单环。环系在环中仅含有碳原子,或者在至少一个环中含有1、2、3个彼此独立地选自氮、氧、C(=O)和硫的杂原子和/或杂原子基团作为环成员。在实施方式中,在所述部分或完全不饱和的环系中的环是未经取代的,或者可以带有一个或多个卤素原子和/或者可以带有1、2或3取代基,独立于环(在两个或多个环的情况下)和取代基地,选自C1-C6-烷基、C1-C6-卤代烷基、C1-C6-烷氧基和C1-C6-卤代烷氧基。在实施方式中,所述环系是部分或完全不饱和的环系。在优选实施方式中,所述部分或完全不饱和的环系是5或6-元单环环系或9或10-元双环环系。环系的实例包括芳基,苯基,苄基,环丙基,杂环,杂芳基,杂芳基-C1-C6-烷基,萘基,4-甲氧基-苄基,呋喃-2-基-甲基,噻吩-2-基-甲基,吡啶-4-基-甲基,1-(4-甲氧基-苯基)-乙基,1-(呋喃-2-基)-乙基,1-(噻吩-2-基)-乙基,1-(吡啶-4-基)-乙基,三唑-1-基-丙基,6-甲氧基-1,2,3,4-四氢-萘-1-基,联苯,螺-[4,4]-二环壬基,二环-[2,2,1-]庚基,7-氧杂-二环-[2,2,1-]庚基,托烷基,和6-二甲基-4,5,6,7-四氢-苯并呋喃-4-基。

[0041] 术语“杂环基”如本文所用(以及在杂环基-C1-C6-烷基中)指具有一个或多个环的饱和或部分不饱和的非芳族环状残基,优选在各环中具有3至7个环成员,其中所述环状残基的1、2或3个环成员是独立地选自O、N和S的杂原子,和/或独立地选自S=O、S(O)₂和其中R是H或C1-C6-烷基的N-R杂原子基团。在两个或多个环的情况下,所述环可以是稠合的或者通过桥联基团或原子来连接。非芳族环的实例包括氮杂环丁烷基,吡咯烷基,吡唑啉基,咪唑啉基,吡咯啉基,吡唑啉基,咪唑啉基,四氢呋喃基,二氢呋喃基,1,3-二氧杂环戊基,二氧杂环戊烯基,硫杂环戊基,二氢噻吩基,噻唑烷基,异噻唑烷基,噻唑啉基,异噻唑啉基,噻唑啉基,异噻唑啉基,噻唑烷基,异噻唑烷基,氧硫杂环戊基,哌啶基,哌嗪基,吡喃基,二氢吡喃基,四氢吡喃基,二噻烷基,噻喃基,二氢噻喃基,四氢噻喃基,吗啉基,噻嗪基等。

[0042] 术语“芳基”(以及在芳基-C1-C6-烷基中)如本文所用指芳族烃环,其可以是单-、双-或三环的。这种环的实例包括苯基,萘基,蒽基,茚基或菲基。优选的芳基是苯基。

[0043] 术语“杂芳基”如本文所用(以及在“杂芳基-C1-C6-烷基”中)指具有一个或多

个环的芳族环状残基,优选在各环中具有 3 至 7 个环成员,更优选在各环中具有 5 或 6 个环成员 (“C5-C6- 杂芳基”或“5- 或 6- 元杂芳基”),其中所述环状残基的 1、2、3 或 4 个环成员是独立地选自 O、N 和 S 的杂原子和 / 或独立地选自 $S=O$ 、 $S(O)_2$ 和其中 R 是 H 或烷基的 N-R 杂原子基团。单环 5- 或 6- 元杂芳族环的实例包括三嗪基,吡嗪基,嘧啶基,哒嗪基,吡啶基,噻吩基,呋喃基,吡咯基,吡唑基,咪唑基,三唑基,四唑基,噻唑基,噁唑基,噻二唑基,噁二唑基,异噻唑基和异噁唑基。

[0044] 术语“芳基 -C1-C6- 烷基”如本文所用 (以及在 C3-C8- 环烷基 -C1-C6- 烷基,杂芳基 -C1-C6- 烷基,杂环 -C1-C6- 烷基中) 指经由所述 C1-C6- 亚烷基的任意碳原子结合至所述分子的剩余部分的各残基。“芳基 -C1-C6- 烷基”的实例是苄基,1- 苯基乙基和 2- 苯基乙基。类似地,芳基 -C2-C6- 烯基和芳基 -C2-C6- 炔基指分别经由所述 C2-C6- 亚烯基和 C2-C6 亚炔基的任意碳原子结合至所述分子的剩余部分的芳基残基。

[0045] 术语“烯型不饱和环”如本文所用意指所述环含有至少一个双键,其可以是 C-C 双键,但也可以是含有至少一个杂原子的双键,例如 $C=N$ 或 $N=N$ 。

[0046] 在优选实施方式中,只要提及 C1-C6- 部分,例如作为 C1-C6- 烷基取代基或残基,C1-C6- 烷氧基,C1-C6- 卤代烷氧基,C1-C6- 烷硫基,C1-C6- 烷基磺酰基,C1-C6- 烷基亚磺酰基,C1-C6- 卤代烷硫基,C1-C6- 卤代烷基,(C1-C6- 烷基) 氨基,二 (C1-C6- 烷基) 氨基等,则独立于部分的所述类型地是 C1-C4- 部分,优选 C1-C3- 部分,例如任意下述基团: C1- 部分, C2- 部分或 C3- 部分。如果存在多于一个烷基部分,则链长可以不同。

[0047] 在优选实施方式中,只要提及 C2-C6- 部分,例如作为 C2-C6- 烯基取代基或残基,C2-C6- 炔基,C2-C6- 卤代烯基,C2-C6- 卤代炔基,C2-C6- 链烯氧基,C2-C6- 烯氧基,C2-C6- 炔氧基等,则独立于部分的所述类型地是 C2-C5- 部分,优选 C2-C4- 部分,例如任意下述基团: C2- 部分, C3- 部分或 C4- 部分。

[0048] 在优选实施方式中,只要提及 C3-C8- 部分,例如作为 C3-C8- 环烷基取代基或残基,C3-C8- 环卤代烷基,C3-C8- 环烷氧基等,则独立于部分的所述类型地是 C3-C5- 部分,例如任意下述基团: C3- 部分,或 C5- 部分。

[0049] 在实施方式中,独立于其它实施方式,W、X、Y 各自分别是 $C-R^3$, $C-R^4$, $C-R^5$, 优选各自是 CH。

[0050] 在实施方式中,独立于其它实施方式,W、X 和 Y 各自分别是 $C-R^3$ 、 $C-R^4$ 和 $C-R^5$,

[0051] R^1 和 R^6 与相邻氮一起形成 3 至 10- 元饱和环,其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员,彼此独立地选自氧、硫、CO、SO、 SO_2 和 $N-R^7$ 和 / 或该环可以带有 1、2 或 3 个残基,彼此独立地各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6- 烷基、C1-C6- 卤代烷基、C1-C6- 烷氧基和 C1-C6- 卤代烷氧基;和

[0052] R^7 如前文所定义。

[0053] 在实施方式中,独立于其它实施方式,

[0054] W 是 N, NO 或 $C-R^3$;

[0055] X 是 N, NO 或 $C-R^4$;

[0056] Y 是 N, NO 或 $C-R^5$;

[0057] R^1 和 R^6 与相邻氮一起形成 3 至 10- 元饱和环,其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员,彼此独立地选自硫、CO、SO、

SO₂ 和 N-R⁷ 和 / 或该环可以带有 1、2 或 3 个残基,彼此独立地各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6-烷基、C1-C6-卤代烷基、C1-C6-烷氧基和 C1-C6-卤代烷氧基;和

[0058] R⁷ 如前文所定义。

[0059] 在实施方式中,独立于其它实施方式,W 和 Y 是 CH 而 X 是 CH 或 N。

[0060] 在实施方式中,独立于其它实施方式,W、X 和 Y 中至少一个是 N 或 NO。优选 W 和 Y 相互独立地是 N 或 NO 而 X 是 CR⁴,或者 W、X 和 Y 各自是 N。

[0061] 在实施方式中,独立于其它实施方式,W 和 Y 分别是 C-R³ 和 C-R⁵,而 X 是 N 或 NO,然后 R¹ 和 R⁶ 与相邻氮一起形成 3 至 10-元饱和环,其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员,彼此独立地选自硫、CO、SO、SO₂ 和 N-R⁷ 和 / 或该环可以带有 1、2 或 3 个残基,彼此独立地各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6-烷基、C1-C6-卤代烷基、C1-C6-烷氧基和 C1-C6-卤代烷氧基。

[0062] 在实施方式中,至少一个 W、X 和 Y 不是 N 或 NO,而此时所述 R¹ 和 R⁶ 与相邻氮一起形成 3 至 10-元饱和环,其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员,彼此独立地选自氧、硫、CO、SO、SO₂ 和 N-R⁷ 和 / 或该环可以带有 1、2 或 3 个残基,彼此独立地各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6-烷基、C1-C6-卤代烷基、C1-C6-烷氧基和 C1-C6-卤代烷氧基。优选至少一个 W、X 和 Y 是 N 或 NO,然后 R¹ 和 R⁶ 与相邻氮一起形成 3 至 10-元饱和环,其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员,彼此独立地选自硫、CO、SO、SO₂ 和 N-R⁷ 和 / 或该环可以带有 1、2 或 3 个残基,彼此独立地各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6-烷基、C1-C6-卤代烷基、C1-C6-烷氧基和 C1-C6-卤代烷氧基。

[0063] 在实施方式中,独立于其它实施方式,R² 是卤素,C1-C6-烷基,C1-C6-卤代烷基,C1-C6-烷氧基,C1-C6-卤代烷氧基或 C1-C6-烷氧基-C1-C6-烷氧基。在优选实施方式中,R² 是卤素,C1-C6-烷基,C1-C6-卤代烷基,C1-C6-烷氧基或 C1-C6-卤代烷氧基。

[0064] 在实施方式中,所述 3 至 10-元环是 5、6、或 7-元环。适宜的实例是 1,7 萘啶基;吗啉基;硫代吗啉基;1,7-萘啶基;2,7-萘啶基;吡嗪并 [2,1-c] [1,4] 噁嗪-3(4H)-酮基;2-氧杂-5-氮杂二环 [2.2.1] 庚烷基;2-硫杂-5-氮杂二环 [2.2.1] 庚烷基;2,5-二氮杂二环 [2.2.1] 庚烷基;哌嗪基;2-吗啉酮基;噻唑烷基;2H-吡啶并 [1,2-a] 吡嗪基;六氢-1H-氮杂**草**基;六氢-1H-硫氮杂**草**基;十氢-喹啉基;六氢-1,4-氧氮杂**草**基;六氢-1,4-二氮杂**草**基;1,4-二氮杂二环 [3.2.1] 辛烷-2-酮基;1,3-二氮杂二环 [3.2.2] 壬烷基;1,4-二氮杂二环 [3.2.1] 辛烷基;1-哌嗪酮基;六氢-1H-1,4-二氮杂**草**基;六氢-1,4-氧氮杂**草**基;2-哌嗪酮基;八氢-呋喃并 [3,4-b] 吡啶基;八氢-呋喃并 [3,4-c] 吡啶基;八氢-吡咯并 [3,4-c] 吡咯基;八氢-吡咯并 [1,2-a] 噻啶基;四氢-1,3,5-三嗪-2(1H)-酮基;八氢-1,5-二氮杂环辛间四烯基;六氢-2H-1,5-硫氮杂环辛间四烯基;六氢-2H-1,5-氧氮杂环辛间四烯基;四氢-2H-1,3-噻嗪基;四氢-2H-1,3-噁嗪基;5-噁唑烷酮基;5-异噁唑烷酮基;5-异噁唑烷基;六氢-哒嗪基;四氢-2H-1,2-噁嗪基;吡唑烷基;3-吡唑烷酮基;四氢-1,3,4-噁二嗪基;四氢-1,2-噁嗪-6-酮基;二氮杂环丙烷基;4-哌啶酮基;3-哌啶酮基;3-吡咯烷酮基;六氢-3H-氮杂**草**-3-酮基;和六氢-4H-氮杂**草**-4-酮基。

[0065] 在实施方式中特别优选的式 I 化合物是那些, 其中 W、X 和 Y 各自是 CH。

[0066] 在实施方式中, 优选的式 I 化合物是那些, 其中 W 和 X 各自是 CH; 而 Y 是卤代 C1 (例如 CF)。

[0067] 在实施方式中, 优选的式 I 化合物是那些, 其中 W 和 Y 各自是 CH; 而 X 是 N, 然后 R¹ 和 R⁶ 与相邻氮一起形成 3 至 10- 元饱和环, 其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员, 彼此独立地选自硫、CO、SO、SO₂ 和 N-R⁷ 和 / 或该环可以带有 1、2 或 3 个残基, 彼此独立地各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6- 烷基、C1-C6- 卤代烷基、C1-C6- 烷氧基和 C1-C6- 卤代烷氧基。

[0068] 在实施方式中, 独立于其它实施方式, 其中 W、X 和 Y 各自是 CH, R² 选自卤素, C1-C6- 烷基, C1-C6- 卤代烷基, C1-C6- 烷氧基和 C1-C6- 卤代烷氧基, 而 R¹ 和 R⁶ 与相邻氮一起形成 3 至 10- 元饱和环, 其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员, 彼此独立地选自氧、硫、CO、SO、SO₂ 和 N-R⁷ 和 / 或该环可以带有 1、2 或 3 个残基, 彼此独立地各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6- 烷基、C1-C6- 卤代烷基、C1-C6- 烷氧基和 C1-C6- 卤代烷氧基; 和

[0069] R⁷ 如前文所定义。

[0070] 在实施方式中, 独立于其它实施方式, 其中 W 和 Y 各自是 CH, X 是 N, R² 选自卤素, C1-C6- 烷基, C1-C6- 卤代烷基, C1-C6- 烷氧基和 C1-C6- 卤代烷氧基, 而 R¹ 和 R⁶ 与相邻氮一起形成 3 至 10- 元饱和环, 其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员, 彼此独立地选自硫、CO、SO、SO₂ 和 N-R⁷ 和 / 或该环可以带有 1、2 或 3 个残基, 彼此独立地各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6- 烷基、C1-C6- 卤代烷基、C1-C6- 烷氧基和 C1-C6- 卤代烷氧基; 和

[0071] R⁷ 如前文所定义。

[0072] 在实施方式中, 独立于其它实施方式, 其中 W 和 Y 各自是 CH, X 是 N, R² 是 C1-C6- 烷氧基, 而 R¹ 和 R⁶ 与相邻氮一起形成 3 至 10- 元饱和环, 其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员, 彼此独立地选自硫、CO、SO、SO₂ 和 N-R⁷ 和 / 或该环可以带有 1、2 或 3 个残基, 彼此独立地各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6- 烷基、C1-C6- 卤代烷基、C1-C6- 烷氧基和 C1-C6- 卤代烷氧基; 和

[0073] R⁷ 如前文所定义。

[0074] 在实施方式中, 独立于其它实施方式, 其中 R¹ 和 R⁶ 与相邻氮一起形成 3 至 10- 元环, 其中该环除了所述氮和碳环成员之外还含有硫原子或选自 CO、SO、和 SO₂ 的基团, 并且该环可以带有 1、2 或 3 个残基, 彼此独立地各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6- 烷基、C1-C6- 卤代烷基、C1-C6- 烷氧基和 C1-C6- 卤代烷氧基。在优选实施方式中, R¹ 和 R⁶ 与相邻氮一起形成 5 元环, 其除了所述氮和碳环成员之外还含有硫原子或选自 CO、SO 和 SO₂ 的基团。在特别优选实施方式中, R¹ 和 R⁶ 与所述相邻氮一起是噻唑烷基。

[0075] 特别优选的式 I 化合物是那些, 其中 W、X 和 Y 各自是 CH; R² 选自卤素, C1-C6- 烷基, C1-C6- 卤代烷基, C1-C6- 烷氧基, C1-C6- 卤代烷氧基或 C1-C6- 烷氧基 -C1-C6- 烷氧基; 而 R¹ 和 R⁶ 选自 1,7 萘啶基; 吗啉基; 硫代吗啉基; 1,7- 萘啶基; 2,7- 萘啶基; 吡嗪并 [2,1-c] [1,4] 噁嗪 -3(4H)- 酮基; 2- 氧杂 -5- 氮杂二环 [2.2.1] 庚烷基; 2- 硫杂 -5- 氮杂二环 [2.2.1] 庚烷基; 2,5- 二氮杂二环 [2.2.1] 庚烷基; 哌嗪基; 2- 吗啉酮基; 噻唑烷基;

2H-吡啶并[1,2-a]吡嗪基;六氢-1H-氮杂**草**基;六氢-1H-硫氮杂**草**基;十氢-喹啉基;六氢-1,4-氧氮杂**草**基;六氢-1,4-二氮杂**草**基;1,4-二氮杂二环[3.2.1]辛烷-2-酮基;1,3-二氮杂二环[3.2.2]壬烷基;1,4-二氮杂二环[3.2.1]辛烷基;1-哌嗪酮基;六氢-1H-1,4-二氮杂**草**基;六氢-1,4-氧氮杂**草**基;2-哌嗪酮基;八氢-呋喃并[3,4-b]吡啶基;八氢-呋喃并[3,4-c]吡啶基;八氢-吡咯并[3,4-c]吡咯基;八氢-吡咯并[1,2-a]噻啶基;四氢-1,3,5-三嗪-2(1H)-酮基;八氢-1,5-二氮杂环辛间四烯基;六氢-2H-1,5-硫氮杂环辛间四烯基;六氢-2H-1,5-氧氮杂环辛间四烯基;四氢-2H-1,3-噻嗪基;四氢-2H-1,3-噁嗪基;5-噁唑烷酮基;5-异噁唑烷酮基;5-异噁唑烷基;六氢-哒嗪基;四氢-2H-1,2-噁嗪基;吡唑烷基;3-吡唑烷酮基;四氢-1,3,4-噁二嗪基;四氢-1,2-噁嗪-6-酮基;二氮杂环丙烷基;4-哌啶酮基;3-哌啶酮基;3-吡咯烷酮基;六氢-3H-氮杂**草**-3-酮基;和六氢-4H-氮杂**草**-4-酮基。

[0076] 在实施方式中,优选的式 I 化合物是那些,其中 W 和 X 各自是 CH;Y 是卤代 C1(例如 CF);R² 选自卤素, C1-C6-烷基, C1-C6-卤代烷基, C1-C6-烷氧基, C1-C6-卤代烷氧基或 C1-C6-烷氧基-C1-C6-烷氧基;而 R¹ 和 R⁶ 选自 1,7 萘啶基;吗啉基;硫代吗啉基;1,7-萘啶基;2,7-萘啶基;吡嗪并[2,1-c][1,4]噁嗪-3(4H)-酮基;2-氧杂-5-氮杂二环[2.2.1]庚烷基;2-硫杂-5-氮杂二环[2.2.1]庚烷基;2,5-二氮杂二环[2.2.1]庚烷基;哌嗪基;2-吗啉酮基;噻唑烷基;2H-吡啶并[1,2-a]吡嗪基;六氢-1H-氮杂**草**基;六氢-1H-硫氮杂**草**基;十氢-喹啉基;六氢-1,4-氧氮杂**草**基;六氢-1,4-二氮杂**草**基;1,4-二氮杂二环[3.2.1]辛烷-2-酮基;1,3-二氮杂二环[3.2.2]壬烷基;1,4-二氮杂二环[3.2.1]辛烷基;1-哌嗪酮基;六氢-1H-1,4-二氮杂**草**基;六氢-1,4-氧氮杂**草**基;2-哌嗪酮基;八氢-呋喃并[3,4-b]吡啶基;八氢-呋喃并[3,4-c]吡啶基;八氢-吡咯并[3,4-c]吡咯基;八氢-吡咯并[1,2-a]噻啶基;四氢-1,3,5-三嗪-2(1H)-酮基;八氢-1,5-二氮杂环辛间四烯基;六氢-2H-1,5-硫氮杂环辛间四烯基;六氢-2H-1,5-氧氮杂环辛间四烯基;四氢-2H-1,3-噻嗪基;四氢-2H-1,3-噁嗪基;5-噁唑烷酮基;5-异噁唑烷酮基;5-异噁唑烷基;六氢-哒嗪基;四氢-2H-1,2-噁嗪基;吡唑烷基;3-吡唑烷酮基;四氢-1,3,4-噁二嗪基;四氢-1,2-噁嗪-6-酮基;二氮杂环丙烷基;4-哌啶酮基;3-哌啶酮基;3-吡咯烷酮基;六氢-3H-氮杂**草**-3-酮基;和六氢-4H-氮杂**草**-4-酮基。

[0077] 在实施方式中,优选的式 I 化合物是那些,其中 W 和 Y 各自是 CH;X 是 N;R² 选自卤素, C1-C6-烷基, C1-C6-卤代烷基, C1-C6-烷氧基, C1-C6-卤代烷氧基或 C1-C6-烷氧基-C1-C6-烷氧基;而 R¹ 和 R⁶ 选自吗啉基;硫代吗啉基;哌嗪基;2-吗啉酮基;噻唑烷基;六氢-1H-氮杂**草**基;六氢-1H-硫氮杂**草**基;六氢-1,4-氧氮杂**草**基;六氢-1,4-二氮杂**草**基;1-哌嗪酮基;六氢-1H-1,4-二氮杂**草**基;六氢-1,4-氧氮杂**草**基;2-哌嗪酮基;四氢-2H-1,3-噻嗪基;四氢-2H-1,3-噁嗪基;5-噁唑烷酮基;5-异噁唑烷酮基;5-异噁唑烷基;六氢-哒嗪基;四氢-2H-1,2-噁嗪基;吡唑烷基;3-吡唑烷酮基;四氢-1,3,4-噁二嗪基;四氢-1,2-噁嗪-6-酮基;二氮杂环丙烷基;4-哌啶酮基;3-哌啶酮基;3-吡咯烷酮基;六氢-3H-氮杂**草**-3-酮基;和六氢-4H-氮杂**草**-4-酮基。

[0078] 在 R² 是氟的情况下,式 I 化合物的优选实施方式是那些,其中 W 和 Y 各自是 CH,而

R^1 和 R^6 与相邻氮一起形成 3 至 10- 元饱和环, 其中该环除了所述氮和碳环成员之外还可以含有 1、2 或 3 个杂原子和 / 或杂原子基团作为环成员, 彼此独立地选自硫、CO、SO₂ 和 N- R^7 和 / 或该环可以带有 1、2 或 3 个残基, 彼此独立地各自选自卤素、氰基、硝基、氨基、C1-C6- 烷基、C1-C6- 卤代烷基、C1-C6- 烷氧基和 C1-C6- 卤代烷氧基。

[0079] 式 I 的具体实施例公开于下述各表。

[0080] 表 1.1 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是甲基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定。

[0081] 表 1.2 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是乙基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0082] 表 1.3 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是三氟甲基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0083] 表 1.4 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是三氯甲基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0084] 表 1.5 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是氟, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0085] 表 1.6 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是氯, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0086] 表 1.7 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是碘, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0087] 表 1.8 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是溴, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0088] 表 1.9 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是甲氧基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0089] 表 1.10 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是三氟甲氧基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0090] 表 1.11 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是三氯甲氧基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0091] 表 1.12 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是二氟甲氧基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0092] 表 1.13 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是二氟氯甲氧基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0093] 表 1.14 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是一氟甲氧基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0094] 表 1.15 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是二氯甲氧基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0095] 表 1.16 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是一氯甲氧基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0096] 表 1.17 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是 OCH₂-OCH₃, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0097] 表 1.18 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是乙氧基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0098] 表 1.19 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是二氟氯甲基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0099] 表 1.20 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是二氟甲基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0100] 表 1.21 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是甲基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0101] 表 1.22 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是乙基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0102] 表 1.23 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是三氟甲基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0103] 表 1.24 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是三氯甲基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0104] 表 1.25 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是氟, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0105] 表 1.26 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是氯, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0106] 表 1.27 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是溴, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0107] 表 1.28 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是碘, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0108] 表 1.29 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是甲氧基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0109] 表 1.30 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是三氟甲氧基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0110] 表 1.31 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是三氯甲氧基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0111] 表 1.32 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是二氟甲氧基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0112] 表 1.33 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是二氟氯甲氧基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0113] 表 1.34 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是二氯甲氧基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0114] 表 1.35 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是一氯甲氧基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0115] 表 1.36 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是乙氧基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 A 中所给定

[0116] 表 1.37 : 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是 OCH_2-OCH_3 , W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R^1 和

R⁶ 的含义如表 A 中所给定

[0117] 表 1.38 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是一氟甲氧基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 A 中所给定

[0118] 表 1.39 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是二氟氯甲基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 A 中所给定

[0119] 表 1.40 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是二氟甲基, W 是 C-H, X 是 C-H, Y 是 C-F, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 A 中所给定

[0120] 表 1.41 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是甲基, W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 B 中所给定

[0121] 表 1.42 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是乙基, W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 B 中所给定

[0122] 表 1.43 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是三氟甲基, W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 B 中所给定

[0123] 表 1.44 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是三氯甲基, W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 B 中所给定

[0124] 表 1.45 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是氟, W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 B 中所给定

[0125] 表 1.46 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是氯, W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 B 中所给定

[0126] 表 1.47 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是溴, W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 B 中所给定

[0127] 表 1.48 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是碘, W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 B 中所给定

[0128] 表 1.49 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是甲氧基, W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 B 中所给定

[0129] 表 1.50 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是三氟甲氧基, W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 B 中所给定

[0130] 表 1.51 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是三氯甲氧基, W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 B 中所给定

[0131] 表 1.52 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是二氟甲氧基, W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 B 中所给定

[0132] 表 1.53 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是一氟甲氧基, W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 B 中所给定

[0133] 表 1.54 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是二氟氯甲氧基 W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 B 中所给定

[0134] 表 1.55 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是二氯甲氧基, W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 B 中所给定

[0135] 表 1.56 : 式 (I) 化合物, 其中 R² 是一氯甲氧基, W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R¹ 和 R⁶ 的含义如表 B 中所给定

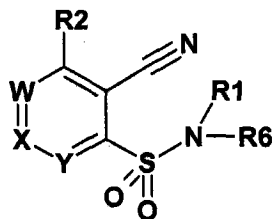
[0136] 表 1.57: 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是乙氧基, W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 B 中所给定

[0137] 表 1.58: 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是 OCH_2-OCH_3 , W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 B 中所给定

[0138] 表 1.59: 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是二氟氯甲基, W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 B 中所给定

[0139] 表 1.60: 式 (I) 化合物, 其中 R^2 是二氟甲基, W 是 C-H, X 是 N, Y 是 C-H, 而 R^1 和 R^6 的含义如表 B 中所给定

[0140]



[0141] 表 A:

[0142]

编号	R^1 和 R^6 与相邻氮一起形成
A1.1	7-甲基-十氢-[1,7]萘啶-1-基
A1.2	1-甲基-十氢-[1,7]萘啶-7-基
A1.3	吗啉-4-基
A1.4	硫代吗啉-4-基
A1.5	7-甲基-十氢-[2,7]萘啶-2-基

[0143]

编号	R ¹ 和 R ⁶ 与相邻氮一起形成
A1.6	2-甲基-十氢-[2,7]萘啶-7-基
A1.7	六氢-吡嗪并[2,1-c][1,4]噁嗪-3-酮-8-基
A1.8	2-氧杂-5-氮杂二环[2.2.1]庚烷-5-基
A1.9	2-硫杂-5-氮杂二环[2.2.1]庚烷-5-基
A1.10	5-甲基-2,5-二氮杂二环[2.2.1]庚烷-2-基
A1.11	4-酰基-哌嗪-1-基
A1.12	吗啉-2-酮-4-基
A1.13	噻唑烷-3-基
A1.14	1,4-二甲基-十氢-吡啶并[3,4-b]吡嗪
A1.15	六氢-氮杂草-1-基
A1.16	六氢-硫氮杂草-4-基
A1.17	八氢-苯并[1,4]噁嗪-4-基
A1.18	六氢-1,4-氧氮杂草-4-基
A1.19	4-甲基-六氢-1,4-二氮杂草-1-基
A1.20	1,4-二氮杂二环[3.2.1]辛烷-2-酮-4-基
A1.21	1,3-二氮杂二环[3.2.2]壬烷-3-基
A1.22	1,4-二氮杂二环[3.2.1]辛烷-4-基
A1.23	哌嗪-2-酮-4-基
A1.24	八氢-呋喃并[3,4-b]吡啶-1-基
A1.25	八氢-呋喃并[3,4-c]吡啶-5-基
A1.26	5-甲基-八氢-吡咯并[3,4-c]吡咯-2-基
A1.27	八氢-吡咯并[1,2-a]嘧啶-1-基
A1.28	1,3-二乙基-四氢-1,3,5-三嗪-2-酮-5-基
A1.29	5-甲基-八氢-1,5-二氮杂环辛间四烯-1-基
A1.30	六氢-2H-1,5-硫氮杂环辛间四烯-5-基
A1.31	六氢-2H-1,5-氧氮杂环辛间四烯-5-基
A1.32	四氢-2H-1,3-噻嗪-3-基
A1.33	四氢-2H-1,3-噁嗪-3-基
A1.34	噁唑烷-5-酮-3-基
A1.35	异噁唑烷-5-酮-2-基
A1.36	异噁唑烷-2-基
A1.37	2-甲基-六氢-哒嗪-1-基
A1.38	四氢-2H-1,2-噁嗪-2-基
A1.39	2-甲基-吡唑烷-1-基
A1.40	3-吡唑烷-3-酮-2-基
A1.41	3-甲基-四氢-1,3,4-噁二嗪-4-基
A1.42	四氢-1,2-噁嗪-6-酮-3-基
A1.43	二氮杂环丙烷-1-基
A1.44	哌啶-4-酮-1-基
A1.45	哌啶-3-酮-1-基
A1.46	吡咯烷-3-酮-1-基
A1.47	六氢-3H-氮杂草-3-酮-1-基
A1.48	六氢-4H-氮杂草-4-酮-1-基

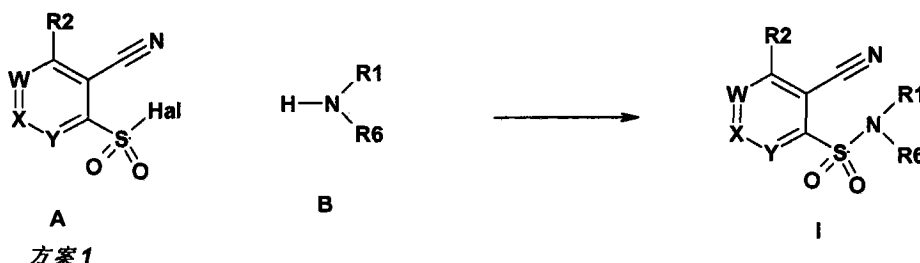
[0144] 表 B:

[0145]

编号	R ¹ 和 R ⁶ 与相邻氮一起形成
B1.1	吗啉-4-基
B1.2	硫代吗啉-4-基
B1.3	4-酰基-哌嗪-1-基
B1.4	吗啉-2-酮-4-基
B1.5	噻唑烷-3-基
B1.6	六氢-氮杂草-1-基
B1.7	六氢-硫氮杂草-4-基
B1.8	六氢-1,4-氧氮杂草-4-基
B1.9	4-甲基-六氢-1,4-二氮杂草-1-基
B1.10	哌嗪-2-酮-4-基
B1.11	四氢-2H-1,3-噻嗪-3-基
B1.12	四氢-2H-1,3-噁嗪-3-基
B1.13	噁唑烷-5-酮-3-基
B1.14	异噁唑烷-5-酮-2-基
B1.15	异噁唑烷-2-基
B1.16	2-甲基-六氢-哒嗪-1-基
B1.17	四氢-2H-1,2-噁嗪-2-基
B1.18	2-甲基-吡唑烷-1-基
B1.19	3-吡唑烷-3-酮-2-基
B1.20	3-甲基-四氢-1,3,4-噁二嗪-4-基
B1.21	四氢-1,2-噁嗪-6-酮-3-基
B1.22	二氮杂环丙烷-1-基
B1.23	哌啶-4-酮-1-基
B1.24	哌啶-3-酮-1-基
B1.25	吡咯烷-3-酮-1-基
B1.26	六氢-3H-氮杂草-3-酮-1-基
B1.27	六氢-4H-氮杂草-4-酮-1-基

[0146] 式 I 化合物, 其中 W、X、Y、R²、R¹ 和 R⁶ 如第一方面中所定义 (也即 W、X 和 Y 中任意个能够是例如 CH₃N 或 NO), 能够这样制备: 将 2- 氰基 - 磺酰卤 A 与氨水或伯胺或仲胺 B 反应。Hal 是卤素, 优选氯或溴, 最优选氯 (参见方案 1)。

[0147]



[0148] 这些反应能够与过去描述的标准方法类似地进行, 所述标准方法是例如在 Duphar EP 33984 的公开中或在 G. Cignarella 和 U. Teotino, J. Am. Chem. Soc. 1960, 82, 1594-1596 的文献中的那些。

[0149] 通常, 按所述磺酰卤 A 计使用 1-2 当量的胺 B。有利地, 在辅剂碱存在下进行反

应。适宜的辅剂碱包括有机碱,例如叔胺,比如脂族叔胺,比如三乙胺或二异丙基乙胺或芳族碱,比如吡啶。

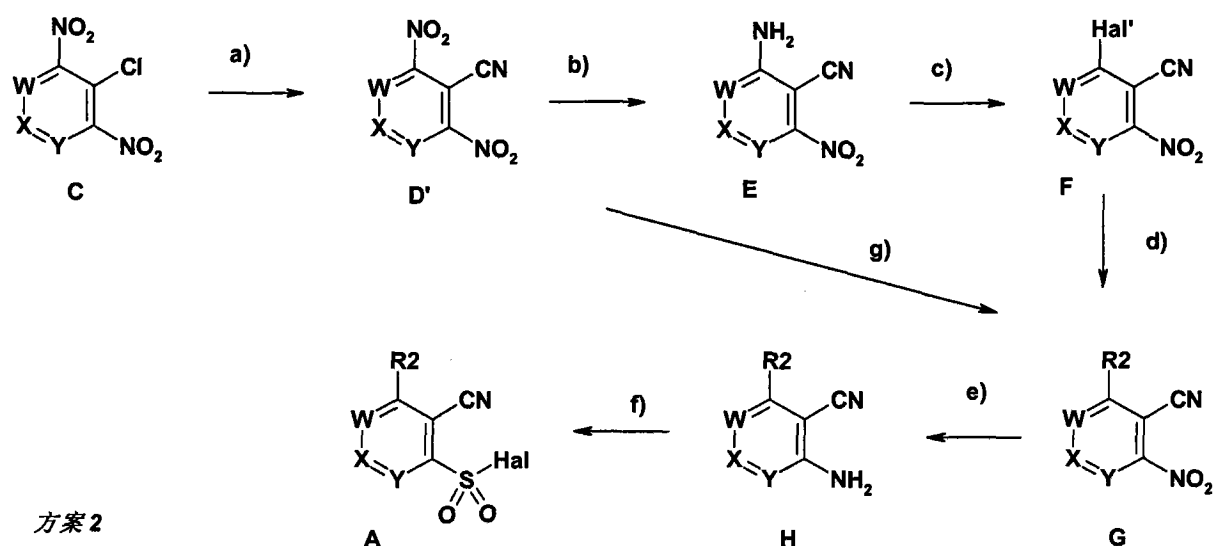
[0150] 所述反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂是醇,比如甲醇或乙醇,二烷基醚,比如二乙醚、二异丙基醚或叔丁基甲基醚,环醚,比如二噁烷或四氢呋喃, N, N- 二甲基甲酰胺,乙腈,水 (条件是所述磺酰卤 A 是足够抗水解的) 或这些溶剂的混合物。

[0151] 所述胺 B 与所述磺酰卤 A 的反应通常在 0℃ 至溶剂沸点,优选 0℃ 至 30℃ 的反应温度下进行。

[0152] 如果不可商购则能够通过本领域技术人员已知的方法制备所述胺 B。

[0153] 新的 2- 氰基 - 磺酰卤能够通过下文所描述的方法制备。与 N. V. Harris 等人的 J. Med. Chem. 1990, 33, 434-444 中描述的方法类似,化合物 D'、E、F 和 G, 优选当 W、X 和 Y 各自是 C-H 时,能够制备自化合物 C。这些中间体 D'、E、F 和 G 能够用标准程序 (方案 2) 转化为所述磺酰卤 A, 所述标准程序是例如 BASF 的公开 W006/056433 中或文献 A. Courtin 的 Helv. Chim. Acta 1976, 59 (42-43), 379-387 中描述的那些。

[0154]



[0155] a) 化合物 C 中的氯原子能够由氰基替代,提供化合物 D'。

[0156] 通常,按化合物 C 计使用 1-2 当量的氰化铜 (I) 或氰化钠。

[0157] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂是环醚,比如二噁烷或四氢呋喃, N, N- 二甲基甲酰胺,乙腈,水或这些溶剂的混合物。

[0158] 所述化合物 C 与所述氰化铜 (I) 的反应通常在 0℃ 至溶剂沸点的反应温度下进行,优选在 N, N- 二甲基甲酰胺中于 140℃ 至 150℃ 下进行。

[0159] b) 通常,用 1.5-3 倍过量的铁粉在浓酸如盐酸存在下来实现化合物 D' 中的一个硝基的还原。

[0160] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂是醇,比如甲醇或乙醇,环醚,比如二噁烷或四氢呋喃,水或这些溶剂的混合物。

[0161] 所述还原通常在 0℃ 至溶剂沸点,优选 70℃ 至 90℃ 的反应温度下进行。

[0162] c) 通常,化合物 E 中的氨基能够这样转化为卤素基团,比如溴化物或氯化物:在浓酸,比如硫酸、冰乙酸、盐酸、氢溴酸或其混合物存在下,将化合物 E 用 1-1.5 当量的亚硝酸钠处理,随后加入 1-2 当量的卤化铜 (I),比如溴化铜 (I) 或氯化铜 (I)。

[0163] 所述转化通常在 0℃至 50℃, 优选 30℃至 45℃的反应温度下进行。为了完成反应, 在氮气释放停止之后, 可以将反应温度升到 80℃至 90℃。

[0164] d¹) 通常, 将 1-2 当量的 MOD 与化合物 F 反应, 其中 M 是碱金属阳离子, 比如钠阳离子, 钾阳离子或铯阳离子, O 是氧而 D 是可以被取代的 C1-C6- 烷基残基。

[0165] MOD, 其中 M 是碱金属阳离子, 比如钠阳离子, 钾阳离子或铯阳离子, O 是氧而 D 是可以被卤素取代的 C1-C6- 烷基残基, 能够这样制备: 将 HOD 与碱金属如钠或者碱金属氢化物如氢化钠反应。

[0166] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂是 HOD, 环醚, 比如二噁烷或四氢呋喃, N, N- 二甲基甲酰胺, N, N- 二甲基乙酰胺, 乙腈, 二甲亚砜, 水或这些溶剂的混合物。

[0167] 所述反应通常在 0℃至溶剂沸点, 优选 80℃至 100℃的反应温度下进行。

[0168] d²) 通常, 化合物 F 在催化量钨催化剂, 比如四(三苯基膦)合钨存在下与 1-2 当量的硼酸、锡化合物或锌化合物反应。

[0169] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂取决于所用试剂是醇, 比如甲醇或乙醇, 二烷基醚, 比如二乙醚、二异丙基醚或叔丁基甲基醚, 环醚, 比如二噁烷或四氢呋喃, N, N- 二甲基甲酰胺, 二甲基甲酰胺, 1,2- 二甲氧基乙烷, 乙腈, 甲苯, 水或这些溶剂的混合物。

[0170] 使用硼酸时, 所述反应通常在碱存在下进行。适宜的碱是碳酸钠, 碳酸钾, 乙酸钠, 磷酸钾或叔丁醇钠。

[0171] 所述反应通常在 0℃至溶剂沸点, 优选 80℃至 100℃的反应温度下进行。

[0172] e) 通常, 用 1.5-3 倍过量铁粉在浓酸如盐酸存在下来实现还原化合物 G 的硝基。

[0173] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂是醇, 比如甲醇或乙醇, 环醚, 比如二噁烷或四氢呋喃, 水或这些溶剂的混合物。

[0174] 所述还原通常在 0℃至溶剂沸点, 优选 70℃至 90℃的反应温度下进行。

[0175] f) 将化合物 H 中的氨基转化为相应重氮盐, 随后在氯化铜(II)存在下将所述重氮盐与二氧化硫反应, 以提供所述磺酰氯 A。

[0176] 适宜的亚硝化剂是亚硝鎗四氟硼酸盐, 亚硝酰氯, 亚硝基硫酸, 亚硝酸烷基酯, 比如亚硝酸叔丁基酯, 或亚硝酸盐, 比如亚硝酸钠。优选使用亚硝酸钠。

[0177] 通常, 将二氧化硫溶于冰乙酸。

[0178] 所述重氮盐还能够与氰酸铜(I)和氰酸钠的混合物反应, 以提供所述氰酸盐化合物, 将其用硫化钠处理, 以提供所述二硫化物化合物。将所述二硫化物化合物在氯存在下用亚硝酸转化为所述磺酰氯 A。

[0179] g) 如果 R² 是 OD, 则所述硝基化合物 D' 能够被转化为化合物 G。

[0180] 通常, 将 1-2 当量的 MOD 与化合物 P 反应, 其中 M 是碱金属阳离子, 比如钠阳离子、钾阳离子或铯阳离子, O 是氧而 D 如前文所定义。

[0181] MOD, 其中 M 是碱金属阳离子, 比如钠阳离子, 钾阳离子或铯阳离子, O 是氧而 D 如前文所定义, 能够这样制备: 将 HOD 与碱金属比如钠或者碱金属氢化物比如氢化钠反应。

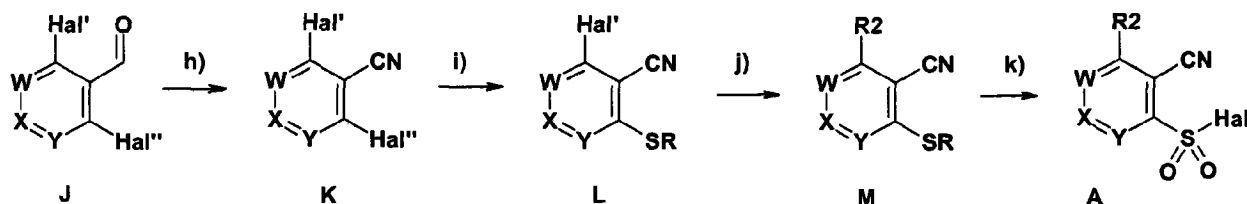
[0182] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂是 HOD, 环醚, 比如二噁烷或四氢呋喃, N, N- 二甲基甲酰胺, N, N- 二甲基乙酰胺, 乙腈, 二甲亚砜, 水或这些溶剂的混合物。

[0183] 所述反应通常在 0℃至溶剂沸点, 优选 80℃至 100℃的反应温度下进行。

[0184] 与标准程序类似, 例如 BASF 的公开 W007/014913 中描述的那些, 化合物 K、L、M 和

A 能够制备自化合物 J(当 W、X、Y 和 R² 如第一方面中所定义), 优选当 W 和 Y 是 CH 而 X 是 N(方案 3) 时。

[0185]



方案 3

[0186] h) 所述醛 J 能够用 1-2 当量的氯化羟铵转化为它的肟。

[0187] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂是醇, 比如甲醇、乙醇、异丙醇或这些溶剂的混合物。

[0188] 通常所述反应在碱存在下进行。适宜的碱包括有机碱, 例如叔胺, 比如脂族叔胺, 比如三乙胺或二异丙基乙胺或者芳族碱, 比如吡啶。

[0189] 所述反应通常在 0°C 至溶剂沸点, 优选 80°C 至 100°C 的反应温度下进行。

[0190] 能够通过用乙酸酐处理所述肟来实现将所述肟脱水成为所述氰基化合物 K。

[0191] 所述反应通常在 0°C 至溶剂沸点, 优选回流条件下的反应温度下进行。

[0192] i) 化合物 K 中的所述卤素, 优选氯或氟, 能够被转化为化合物 L 中它的硫醚, 其中 R 是 C1-C4-烷基或芳基, 比如丙基或异丙基或苄基。

[0193] 通常, 将化合物 K 与 1-2 当量的烷基或苄基硫醇反应。

[0194] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂是二烷基醚, 比如二乙醚、二异丙基醚或叔丁基甲基醚, 环醚, 比如二噁烷或四氢呋喃, N, N-二甲基甲酰胺, 乙腈或这些溶剂的混合物。

[0195] 通常, 所述反应在碱存在下进行。适宜的碱是金属氢化物, 比如氢化钠, 或者金属碳酸盐, 比如碳酸锂、碳酸钠、碳酸钾或碳酸钙或者金属碳酸氢盐, 比如碳酸氢钠。

[0196] 所述反应通常在 0°C 至溶剂沸点的反应温度下进行。

[0197] j¹) 通常, 将 1-2 当量的 MOD 与化合物 L 反应, 其中 M 是碱金属阳离子, 比如钠阳离子、钾阳离子或铯阳离子, O 是氧而 D 如前文所定义。

[0198] MOD, 其中 M 是碱金属阳离子, 比如钠阳离子、钾阳离子或铯阳离子, O 是氧而 D 如前文所定义, 能够这样制备: 将 HOD 与碱金属比如钠或者碱金属氢化物比如氢化钠反应。

[0199] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂是 HOD, 环醚, 比如二噁烷或四氢呋喃, N, N-二甲基甲酰胺, N, N-二甲基乙酰胺, 乙腈, 二甲亚砜, 水或这些溶剂的混合物。

[0200] 所述反应通常在 0°C 至溶剂沸点, 优选 80°C 至 100°C 的反应温度下进行。

[0201] j²) 通常, 化合物 L 在催化量钯催化剂比如四(三苯基膦)合钯存在下与 1-2 当量的硼酸、锡化合物或锌化合物反应。

[0202] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂取决于所用试剂是醇, 比如甲醇或乙醇, 二烷基醚, 比如二乙醚、二异丙基醚或叔丁基甲基醚, 环醚, 比如二噁烷或四氢呋喃, N, N-二甲基甲酰胺, 二甲基甲酰胺, 1,2-二甲氧基乙烷, 乙腈, 甲苯, 水或这些溶剂的混合物。

[0203] 当使用硼酸时, 所述反应通常在碱存在下进行。适宜的碱是碳酸钠, 碳酸钾, 乙酸

钠, 磷酸钾或叔丁醇钠。

[0204] 所述反应通常在 0℃ 至溶剂沸点, 优选 80℃ 至 100℃ 的反应温度下进行。

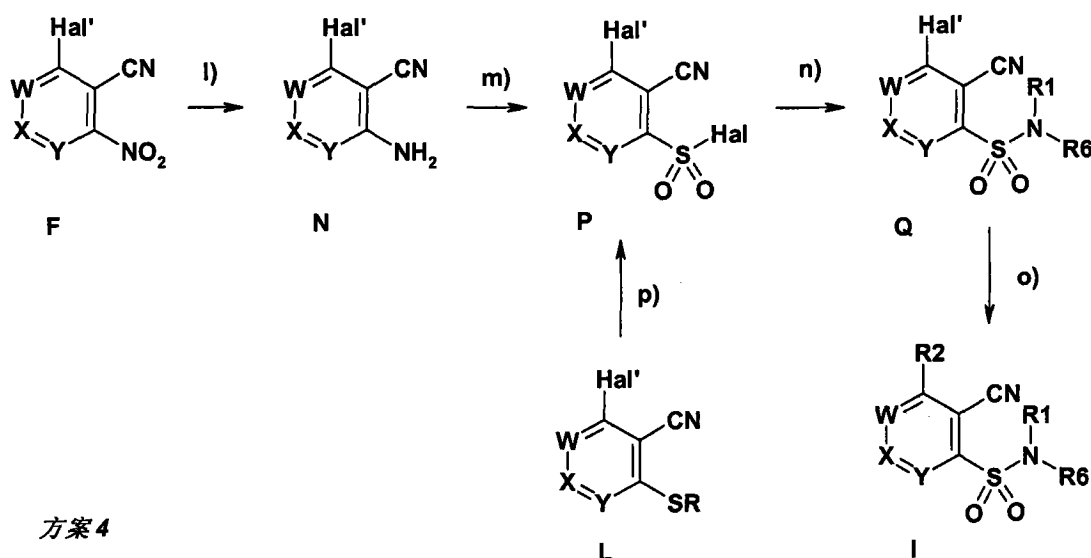
[0205] k) 通常通过将化合物 M 与氯气反应进行硫醚化合物 M 的氧化裂解以得到其中 Hal 是氯的磺酰卤 A。

[0206] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂是卤化的有机溶剂, 比如氯仿, 苯基氯, 乙酸, 水或优选这些溶剂中 2 或 3 种的混合物。

[0207] 所述二卤代化合物 J 能够与文献例如 V. Bertini 的 *Heterocycles* 1995, 41 (4), 675-88 中所描述的程序或者本领域技术人员已知的程序类似地制备。

[0208] 可以在之后阶段或合成末尾引入所述取代基 R² 或者其它取代基 R³、R⁴ 或 R⁵ 以获得结构 I 的新磺酰胺。尤其是如果所述取代基在上述反应条件下不稳定, 则推荐此法。例如, R² 的引入示于方案 4 中。

[0209]



[0210] 1) 硝基化合物 F 能够还原为所述氨基化合物 N。通常, 在浓酸比如盐酸存在下用 1.5-3 倍过量铁粉来实现化合物 F 中所述硝基的还原。

[0211] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂是醇, 比如甲醇或乙醇, 环醚, 比如二噁烷或四氢呋喃, 水或这些溶剂的混合物。

[0212] 所述还原通常在 0℃ 至溶剂沸点, 优选 70℃ 至 90℃ 的反应温度下进行。

[0213] m) 将化合物 N 中的氨基转化为相应重氮盐, 随后在氯化铜 (II) 存在下将所述重氮盐与二氧化物反应以提供所述磺酰氯 P。

[0214] 适宜的亚硝化剂是亚硝鎗四氟硼酸盐, 亚硝酰氯, 亚硝基硫酸, 亚硝酸烷基酯, 比如亚硝酸叔丁基酯, 或亚硝酸盐, 比如亚硝酸钠。优选使用亚硝酸钠。

[0215] 通常, 将二氧化硫溶于冰乙酸。

[0216] 所述重氮盐还能够与氰酸铜 (I) 和氰酸钠的混合物反应以提供氰酸盐化合物, 将其用硫化钠处理以提供所述二硫化物化合物。所述二硫化物化合物在氯存在下用亚硝酸转化为所述磺酰氯 P。

[0217] n) 所述磺酰氯 P 反应生成磺酰胺 Q。通常, 按磺酰氯 P 计使用 1-2 当量的胺。可以有利地在辅剂碱存在下进行所述反应。适宜的辅剂碱包括有机碱, 例如叔胺, 比如脂族叔

胺,比如三乙胺或二异丙基乙胺或芳族碱,比如吡啶。

[0218] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂是醇,比如甲醇或乙醇,二烷基醚,比如二乙醚,二异丙基醚或叔丁基甲基醚,环醚,比如二噁烷或四氢呋喃,N,N-二甲基甲酰胺,乙腈,水(条件是所述磺酰卤A足够抗水解)或这些溶剂的混合物。

[0219] 所述胺与所述磺酰卤P的反应通常在0℃至溶剂沸点,优选0℃至30℃的反应温度下进行。

[0220] 如果不可商购则所述胺可以通过制备伯胺或仲胺的标准方法来制备。

[0221] o¹) 通常,将1-2当量的MOD与化合物P反应,其中M是碱金属阳离子,比如钠阳离子、钾阳离子或铯阳离子,O是氧而D如前文所定义。

[0222] MOD,其中M是碱金属阳离子,比如钠阳离子、钾阳离子或铯阳离子,O是氧而D如前文所定义,能够这样制备:将HOD与碱金属比如钠或碱金属氢化物比如氢化钠反应。

[0223] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂是HOD,环醚,比如二噁烷或四氢呋喃,N,N-二甲基甲酰胺,N,N-二甲基乙酰胺,乙腈,二甲亚砜,水或这些溶剂的混合物。

[0224] 所述反应通常在0℃至溶剂沸点,优选80℃至100℃的反应温度下进行。

[0225] o³) 通常,在催化量钯催化剂比如四(三苯基膦)合钯存在下化合物P与1-2当量的硼酸、锡化合物或锌化合物反应。

[0226] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂取决于所用试剂是醇,比如甲醇或乙醇,二烷基醚,比如二乙醚、二异丙基醚或叔丁基甲基醚,环醚,比如二噁烷或四氢呋喃,N,N-二甲基甲酰胺,二甲基甲酰胺,1,2-二甲氧基乙烷,乙腈,甲苯,水或这些溶剂的混合物。

[0227] 当使用硼酸时,所述反应通常在碱存在下进行。适宜的碱是碳酸钠,碳酸钾,乙酸钠,磷酸钾或叔丁醇钠。

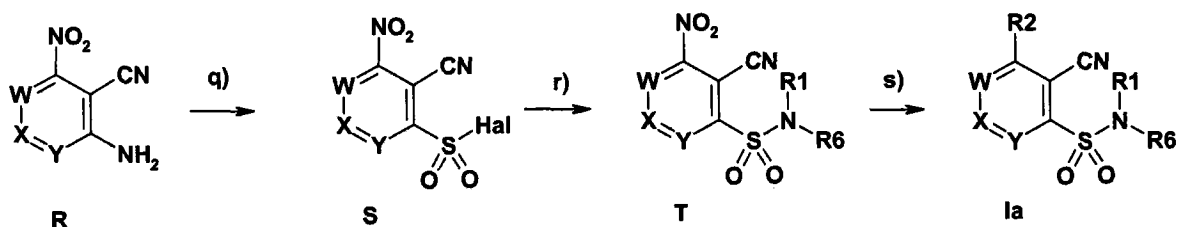
[0228] 所述反应通常在0℃至溶剂沸点,优选80℃至100℃的反应温度下进行。

[0229] p) 将L与氯反应也能够制备其中Hal是氯的中间体P。

[0230] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂是卤化的有机溶剂,比如氯仿,苯基氯,乙酸,水或优选这些溶剂中2或3种的混合物。

[0231] 当R²是OD(D是可被卤素取代的C1-C6-烷基残基)时,特别是当W、X和Y各自分别是CR³、CR⁴和CR⁵时,在合成末尾引入R²的另一可能示于方案5中。

[0232]



方案5

[0233] q) 将化合物R中的所述氨基转化为相应重氮盐,随后在氯化铜(II)存在下将所述重氮盐与二氧化物反应以提供所述磺酰氯S。

[0234] 适宜的亚硝化剂是亚硝鎗四氟硼酸盐,亚硝酰氯,亚硝基硫酸,亚硝酸烷基酯,比如亚硝酸叔丁基酯,或亚硝酸盐,比如亚硝酸钠。优选使用亚硝酸钠。

[0235] 通常,将二氧化硫溶于冰乙酸。

[0236] 所述重氮盐还能够与氰酸铜(I)和氰酸钠的混合物反应以提供氰酸盐化合物,将其用硫化钠处理以提供所述二硫化物化合物。将所述二硫化物化合物在氯存在下用亚硝酸转化为所述磺酰氯 S。

[0237] r) 将所述磺酰氯 S 反应生成所述磺酰胺 T(式 I 的实施方式)。通常,按磺酰卤 S 计使用 1-2 当量的胺。可以有利地在辅剂碱存在下进行所述反应。适宜的辅剂碱包括有机碱,例如叔胺,比如脂族叔胺,比如三乙胺或二异丙基乙胺或芳族碱,比如吡啶。

[0238] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂是醇,比如甲醇或乙醇,二烷基醚,比如二乙醚、二异丙基醚或叔丁基甲基醚,环醚,比如二噁烷或四氢呋喃,N,N-二甲基甲酰胺,乙腈,水(条件是所述磺酰卤 A 足够抗水解)或这些溶剂的混合物。

[0239] 所述胺与所述磺酰卤 S 的反应通常在 0°C 至溶剂沸点,优选 0°C 至 30°C 的反应温度下进行。

[0240] 如果不可商购则可以通过制备伯胺或仲胺的标准方法来制备所述胺。

[0241] s) 通常,将 1-2 当量的 MOD 与化合物 T 反应,其中 M 是碱金属阳离子,比如钠阳离子、钾阳离子或铯阳离子, O 是氧而 D 如前文所定义。

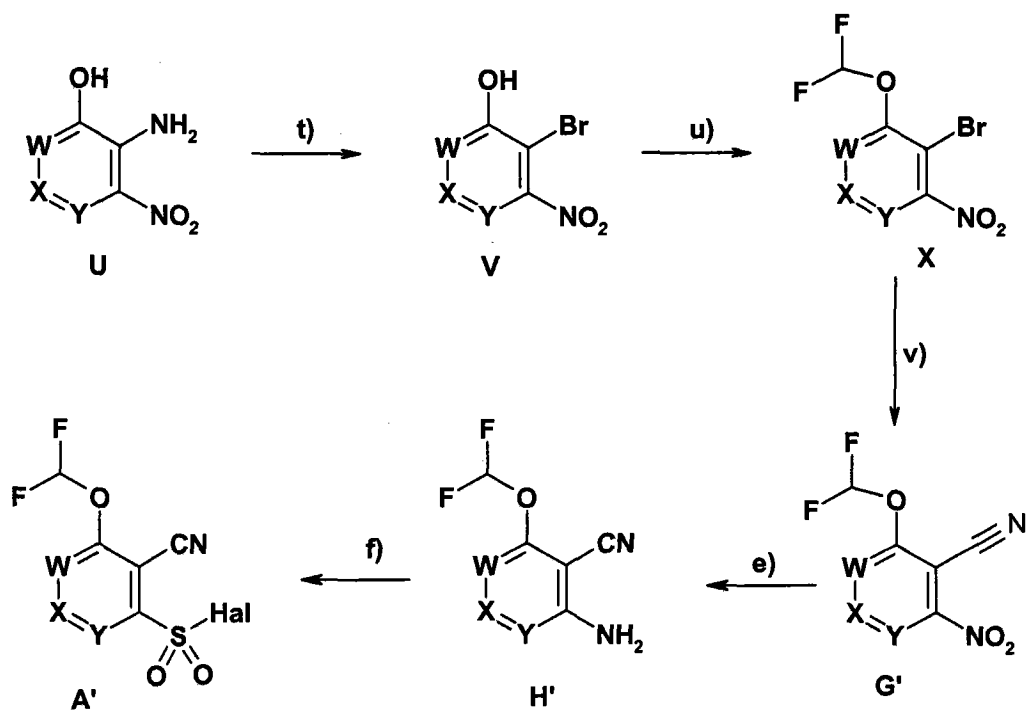
[0242] MOD,其中 M 是碱金属阳离子,比如钠阳离子、钾阳离子或铯阳离子, O 是氧而 D 如前文所定义,能够这样制备:将 HOD 与碱金属比如钠或碱金属氢化物比如氢化钠反应。

[0243] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂是 HOD,环醚,比如二噁烷或四氢呋喃,N,N-二甲基甲酰胺,N,N-二甲基乙酰胺,乙腈,二甲亚砜,水或这些溶剂的混合物。

[0244] 所述反应通常在 0°C 至溶剂沸点,优选 80°C 至 100°C 的反应温度下进行。

[0245] 新的 2- 氰基 - 磺酰卤还能够通过下文所描述的方法(方案 6)来制备。

[0246]



方案6

[0247] t) 通常,化合物 U 中的氨基可以这样转化为卤素,比如溴化物:在浓酸,比如硫酸、

冰乙酸、盐酸、氢溴酸或其混合物存在下将化合物 U 用 1-1.5 当量的亚硝酸钠处理,随后加入 1-2 当量的卤化铜 (I),比如溴化铜 (I) 或氯化铜 (I)。

[0248] 所述转化通常在 0℃至 50℃,优选 30℃至 45℃的反应温度下进行。为了完成反应,在氮气释放停止之后,可将反应温度升至 80℃至 90℃。

[0249] u) 化合物 X 的二氟甲基可以通过这样烷基化化合物 V 的酚基来引入:用氯二氟甲烷和碱处理或者用氯二氟乙酸或其盐和碱处理。

[0250] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂取决于所用试剂是醇,比如甲醇或乙醇,二烷基醚,比如二乙醚、二异丙基醚或叔丁基甲基醚,环醚,比如二噁烷或四氢呋喃, N, N-二甲基甲酰胺,二甲基甲酰胺, 1,2-二甲氧基乙烷,乙腈,甲苯,水或这些溶剂的混合物。

[0251] 所述反应在碱存在下进行。适宜的碱是氢氧化钠,氢氧化钾,碳酸钠,碳酸钾或叔丁醇钠。

[0252] 所述反应通常在 0℃至溶剂沸点,优选 80℃至 100℃的反应温度下进行。

[0253] 所述二卤代化合物 X 可以与文献例如 Helvetica Chimia Acta 1995, 88, 1044-1046 中所描述的程序或本领域技术人员已知的程序类似地制备。

[0254] v) 化合物 X 中的溴原子可以被氰基替代以提供化合物 G'。

[0255] 通常,按化合物 X' 计使用 1-2 当量的氰化铜 (I) 或氰化钠。

[0256] 反应通常在溶剂存在下进行。适宜的溶剂是环醚,比如二噁烷或四氢呋喃, N, N-二甲基甲酰胺,乙腈,水或这些溶剂的混合物。

[0257] 化合物 X 与氰化铜 (I) 的反应通常在 0℃至溶剂沸点的反应温度下,优选在微波炉中于密封管中在 N, N-二甲基甲酰胺中于 140℃至 150℃或更高的温度下进行。

[0258] 此后,反应步骤 (e) 和 (f) (如上所述) 提供相应的磺酰卤。

[0259] 技术人员将理解对于式 I 的具体的氰基-取代苯基化合物和其相应含氮衍生物化合物可以需要对上述反应条件的适当变化。

[0260] 式 I 化合物能够以本身已知的方式这样转化为另一种式 I 化合物:由根据本发明的其它取代基以常规方式来替代起始式 I 化合物的一个或多个取代基。

[0261] 根据各情况下适合的反应条件和原料的选择,可以例如在一步反应中用根据本发明的另一取代基仅替换一个取代基,或可在相同反应步骤中用根据本发明的其它取代基替换多个取代基。

[0262] 式 I 化合物的盐可以以本身已知的方法制备。因此,例如通过用适宜的酸或适宜的离子交换剂处理得到化合物 I 的酸加成盐而通过用适宜的碱和适宜的离子交换剂处理得到含碱的盐。

[0263] 化合物 I 的盐能以常规方式转化为游离的化合物 I,例如通过用适宜的碱性化合物或用适宜的离子交换剂处理酸加成盐,以及例如通过用适宜的酸或用适宜的离子交换剂处理含碱的盐。

[0264] 式 I 化合物的盐能以本身已知的方式转化为式 I 化合物的其它盐,例如通过在适宜的溶剂中用适宜的金属盐处理无机酸盐如盐酸盐,所述适宜的金属盐是比如酸的钠、钡或银盐,例如醋酸银,在所述适宜的溶剂中形成的无机盐如氯化银是不可溶的,因此自反应混合物中沉淀,由此将例如酸加成盐转化为其它酸加成盐。

[0265] 根据程序或反应条件,能以游离形式或盐形式得到具有成盐特性的式 I 化合物。

[0266] 适用于根据本发明的用途的所述式 I 化合物的盐特别是农业上可接受的盐。它们能够以常规方法形成,例如通过将所述化合物与相应阴离子的酸反应。

[0267] 适宜的农业上可使用的盐尤其是这种阳离子的盐或者这种酸的酸加成盐,其阳离子和阴离子分别对根据本发明的化合物的作用不具有任何有害影响,其可用于对抗有害昆虫、蛛形动物和 / 或线虫。因此,适宜的阳离子尤其是下述物质的离子:碱金属,优选锂、钠和钾,碱土金属,优选钙、镁和钡,以及过渡金属,优选锰、铜、锌和铁,以及铵离子,其根据希望可以带有 1-4 个 C1-C4- 烷基取代基和 / 或 1 个苯基或苄基取代基,优选二异丙基铵、四甲基铵、四丁基铵、三甲基苄基铵,以及磷离子,铈离子,优选三 (C1-C4- 烷基) 铈,和氧化铈离子,优选三 (C1-C4- 烷基) 氧化铈。

[0268] 有用酸加成盐的阴离子主要是氯离子、溴离子、氟离子、硫酸氢根离子、硫酸根离子、磷酸二氢根离子、氢阴离子、氢氧根离子、磷酸氢根离子、磷酸根离子、硝酸根离子、碳酸氢根离子、碳酸根离子、六氟硅酸根离子、六氟磷酸根离子、苯甲酸根离子和 C1-C4- 链烷酸的阴离子,优选甲酸根离子、乙酸根离子、丙酸根离子和丁酸根离子。它们可以通过将式 I 化合物与相应阴离子的酸反应来形成,优选盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸或硝酸。适宜盐还包括式 I 与比如马来酸、二马来酸 (dimaleic acid)、富马酸、二富马酸 (difumaric acid) 和甲磺酸的加合物。

[0269] 根据在分子中存在的不对称碳原子的数目、绝对和相对构型和 / 或取决于分子中存在的非芳族双键的构型,在各情况下为游离形式或成盐形式的式 I 化合物以及适当时其互变异构体,能以可能的异构体之一的形式或者以其混合物的形式存在,例如以纯异构体形式,比如对映体和 / 或非对映体,或作为异构体混合物,比如对映异构体混合物,例如外消旋体,非对映体混合物或外消旋体混合物;本发明涉及该纯异构体并且也涉及所有可能的异构体混合物,而且在上下文中的各情况下都应如此理解,即使立体化学细节未在所有情况下明确提及。

[0270] 可根据选择的原料和程序获得的游离形式或成盐形式的式 I 化合物的非对映体混合物或外消旋体混合物,可基于组分间的物理化学差异以已知的方式分离为纯非对映体或外消旋体,例如通过分步结晶、蒸馏和 / 或色谱法。

[0271] 能以类似方式得到的对映异构体混合物,比如外消旋体能通过已知方法拆分为旋光对映体,所述已知方法是例如从旋光溶剂中重结晶,在手性吸附剂上进行色谱分离,例如在乙酰纤维素上进行高效液相色谱法 (HPLC) 分离,借助适宜的微生物,用专门的固定化酶分开,形成包合物,例如使用只配合一种对映体的手性冠醚,或转化为非对映体盐,例如通过将碱性终产物的外消旋体与旋光性酸反应,所述旋光性酸是比如羧酸,例如樟脑酸 (camphor)、酒石酸或苹果酸,或磺酸,例如樟脑磺酸,接着分离以此方式可获得的非对映体,例如基于其不同的溶解度分步结晶,提供非对映体,通过合适试剂如碱性试剂的作用可使希望的对映异构体从中游离出来。

[0272] 按照本发明,纯非对映体或对映体不仅能通过分离适宜的异构体混合物得到,还能通过通常已知的非对映选择性或对映选择性合成得到,例如通过用适宜的立体化学原料来进行本发明的方法。

[0273] 如果该单个组分具有不同的生物活性,在各情况下分离或合成生物上更有效的异构体是有利的,所述异构体是例如,对映体或非对映体,或异构体混合物,例如对映体混合

物或非对映体混合物。

[0274] 在各情况下游离形式或成盐形式的式 I 化合物和适当时其互变异构体,如果适当,可以水化物形式得到和 / 或包含其它溶剂,例如可用于结晶以固体形式存在的化合物的那些溶剂。

[0275] 本文中还可获得的是所述式 I 化合物的新中间体化合物。

[0276] 本发明的化合物 I 是在病虫害防治领域,即使是在低施用率下,有预防和 / 或治疗价值的活性成分,其具有非常有利的杀生物谱而且被温血物种、鱼和植物很好地耐受。本发明的活性成分不仅对通常敏感的而且对抗性的动物病虫害的全部或单个发育阶段起作用,所述病虫害是比如昆虫或蜚蠊目的典型生物。本发明活性成分的杀昆虫或杀螨活性能自己直接地显现,也即,立刻或仅过一段时间后例如在蜕皮期间发生病虫害灭除,或间接地显现,例如产卵和 / 或孵化率减少,其显示相当于至少 50% 到 60% 的灭除率(死亡率)的良好活性。

[0277] 所述式 I 化合物(包括式 Ia、Ib、Ic 和 Id 的化合物)及其组合物适用于,尤其是在植物保护中,有效防治昆虫纲(Insecta)、蛛形纲(Arachnida)和 / 或线虫纲(Nematoda)的病虫害。特别地,它们适用于防治下述动物病虫害:

[0278] 鳞翅目(Lepidoptera)的昆虫,例如小地老虎(*Agrotis ypsilon*),黄地老虎(*Agrotis segetum*),Alabama argillacea,大豆夜蛾(*Anticarsia gemmatalis*),苹果银蛾(*Argyresthia conj ugella*),丫蚊夜蛾(*Autographa gamma*),松粉蝶尺蛾(*Bupalus piniarius*),Cacoecia murinana,网纹烟卷蛾(*Capua reticulana*),果园秋尺蛾(*Cheimatobia brumata*),云杉色卷蛾(*Choristoneura fumiferana*),西部云杉色卷蛾(*Choristoneura occidentalis*),一星粘虫(*Cirphis unipuncta*),苹果皮小卷蛾(*Cydia pomonella*),普通松毛虫(*Dendrolimus pini*),瓜野螟(*Diaphania nitidalis*),西南玉米秆草螟(*Diatraea grandiosella*),埃及钻夜蛾(*Earias insulana*),玉米小秆螟(*Elasmopalpus lignosellus*),女贞细卷蛾(*Eupoecilia ambiguella*),Evetria bouliana,地下芜菁夜蛾(*Feltiasubterranea*),蜡螟(*Galleria mellonella*),李小食心虫(*Grapholitha funebrana*),梨小食心虫(*Grapholitha molesta*),棉铃虫(*Heliothis armigera*),烟芽夜蛾(*Heliothis virescens*),棉铃虫(*Heliothis zea*),菜心螟(*Hellula undalis*),Hibernia defoliaria,美国白蛾(*Hyphantria cunea*),苹果巢蛾(*Hyponomeuta malinellus*),番茄茎麦蛾(*Keiferia lycopersicella*),铁杉尺蠖(*Lambdina fiscellaria*),甜菜夜蛾(*Laphygma exigua*),咖啡一点潜蛾(*Leucoptera coffeella*),旋纹潜蛾(*Leucoptera scitella*),Lithocolletis blancardella,鲜食葡萄小卷蛾(*Lobesia botrana*),网锥额野螟(*Loxostege sticticalis*),舞毒蛾(*Lymantria dispar*),僧尼舞毒蛾(*Lymantria monacha*),窄翅潜叶蛾(*Lyonetia clerkella*),黄褐天幕毛虫(*Malacosoma neustria*),甘蓝夜蛾(*Mamestra brassicae*),黄杉合毒蛾(*Orgyia pseudotsugata*),欧洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis*),小眼夜蛾(*Panolis flammea*),棉红铃虫(*Pectinophora gossypiella*),疆夜蛾(*Peridroma saucia*),栎牛头天社蛾(*Phalera bucephala*),马铃薯麦蛾(*Phthorimaea operculella*),柑橘叶潜蛾(*Phyllocnistis citrella*),欧洲粉蝶(*Pieris brassicae*),苜蓿绿夜蛾(*Plathypena scabra*),小菜蛾(*Plutella xylostella*),大豆尺夜蛾(*Pseudoplusia includens*),美松梢小卷蛾

(*Rhyacionia frustrana*), *Scrobipalpula absoluta*, 麦蛾 (*Sitotroga cerealella*), 葡萄长须卷蛾 (*Sparganothis pilleriana*), 草地夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*), 棉贪夜蛾 (*Spodoptera littoralis*), 斜纹贪夜蛾 (*Spodoptera litura*), 松异舟蛾 (*Thaumtopoea pityocampa*), 栎绿卷蛾 (*Tortrix viridana*), 粉斑夜蛾 (*Trichoplusia ni*) 和云杉线小卷蛾 (*Zeiraphera canadensis*);

[0279] 鞘翅目 (Coleoptera), 例如梨长吉丁 (*Agrilus sinuatus*), 直条叩甲 (*Agriotes lineatus*), 暗叩甲 (*Agriotes obscurus*), 六月金龟子 (*Amphimallus solstitialis*), 异性小蠹 (*Anisandrus dispar*), 棉铃象 (*Anthonomus grandis*), 梨花象甲 (*Anthonomus pomorum*), 甜菜隐食甲 (*Atomaria linearis*), 大松小蠹 (*Blastophagus piniperda*), *Blitophaga undata*, 蚕豆象 (*Bruchus rufimanus*), 豌豆象 (*Bruchus pisorum*), 小扁豆豆象 (*Bruchus lentis*), 葡萄卷叶象甲 (*Byctiscus betulae*), 甜菜龟甲 (*Cassida nebulosa*), 菜豆萤叶甲 (*Cerotoma trifurcata*), 白菜籽龟象 (*Ceuthorrhynchus assimilis*), 油菜茎象甲 (*Ceuthorrhynchus napi*), 蚤凹胫跳甲 (*Chaetocnema tibialis*), 烟草金针虫 (*Conoderus vespertinus*), 石刁柏负泥虫 (*Crioceris asparagi*), 黄瓜条叶甲 (*Diabrotica balteata*), 长角叶甲 (*Diabrotica longicornis*), 12 星瓜叶甲 (*Diabrotica 12-punctata*), 玉米叶根虫 (*Diabrotica virgifera*), 墨西哥豆瓢虫 (*Epilachna varivestis*), 烟草跳甲 (*Epitrix hirtipennis*), 棉籽灰象甲 (*Eutinobothrus brasiliensis*), 松大象甲 (*Hylobius abietis*), 埃及苜蓿象甲 (*Hypera brunneipennis*), 紫苜蓿叶象 (*Hypera postica*), 八齿小蠹虫 (*Ips typographus*), 烟草负泥虫 (*Lema bilineata*), 禾谷负泥虫 (*Lema melanopus*), 马铃薯叶甲 (*Leptinotarsa decemlineata*), 甜菜叩甲 (*Limonius californicus*), 稻水象 (*Lissorhoptrus oryzophilus*), 玉米叩甲 (*Melanotus communis*), 油菜花露尾甲 (*Meligethes aeneus*), 大栗鳃金龟 (*Melolontha hippocastani*), 五月鳃金龟 (*Melolontha melolontha*), 水稻负泥虫 (*Oulema oryzae*), 葡萄黑象甲 (*Ortiorrhynchus sulcatus*), 草莓根象甲 (*Otiorrhynchus ovatus*), 辣根猿叶甲 (*Phaedon cochleariae*), 油菜蓝跳甲 (*Phyllotreta chrysocephala*), 食叶鳃金龟属 (*Phyllophaga* sp.), 果园丽金龟 (*Phyllopertha horticola*), 芜菁淡足跳甲 (*Phyllotreta nemorum*), 黄曲条菜跳甲 (*Phyllotreta striolata*), 日本弧丽金龟 (*Popillia japonica*), 直条根瘤象 (*Sitona lineatus*) 和谷象 (*Sitophilus granaria*);

[0280] 双翅目 (Diptera), 例如埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*), 刺扰伊蚊 (*Aedes vexans*), 墨西哥按实蝇 (*Anastrepha ludens*), 五斑按蚊 (*Anopheles maculipennis*), 地中海实蝇 (*Ceratitis capitata*), 蛆症金蝇 (*Chrysomya bezziana*), 嗜人金蝇 (*Chrysomya hominivorax*), 腐败金蝇 (*Chrysomya macellaria*), 高粱瘿蚊 (*Contarinia sorghicola*), 皮蛆蝇 (*Cordylobia anthropophaga*), 尖音库蚊 (*Culex pipiens*), 瓜实蝇 (*Dacus cucurbitae*), 油橄榄果实蝇 (*Dacus oleae*), 甘蓝瘿蚊 (*Dasineura brassicae*), 夏厕蝇 (*Fannia canicularis*), 肠胃蝇 (*Gasterophilus intestinalis*), 刺舌蝇 (*Glossina morsitans*), 西方角蝇 (*Haematobia irritans*), 鞍瘿蚊 (*Haplodiplosis equestris*), 种蝇 (*Hylemyiaplatura*), 纹皮蝇 (*Hypoderma lineata*), 菜潜叶蝇 (*Liriomyza sativae*), 三叶草斑潜蝇 (*Liriomyza trifolii*), 羊绿蝇 (*Lucilia caprina*), 铜绿蝇 (*Lucilia cuprina*), 丝光绿蝇 (*Lucilia sericata*), *Lycoria pectoralis*, 小麦瘿蚊 (*Mayetiola*

destructor), 家蝇 (*Musca domestica*), 厩腐蝇 (*Muscina stabulans*), 羊狂蝇 (*Oestrus ovis*), 瑞典麦秆蝇 (*Oscinella frit*), *Pegomya hysocyami*, 古草种蝇 (*Phorbia antiqua*), 甘蓝草种蝇 (*Phorbia brassicae*), 冬作草种蝇 (*Phorbia coarctata*), 樱桃绕实蝇 (*Rhagoletis cerasi*), 苹绕实蝇 (*Rhagoletis pomonella*), 牛虻 (*Tabanus bovinus*), 甘蓝大蚊 (*Tipula oleracea*) 和欧洲大蚊 (*Tipula paludosa*);

[0281] 缨翅目 (Thysanoptera), 例如烟草褐花蓟马 (*Frankliniella fusca*), 西花蓟马 (*Frankliniella occidentalis*), 东方花蓟马 (*Frankliniella tritici*), 桔实蓟马 (*Scirtothrips citri*), 稻蓟马 (*Thrips oryzae*), 棕榈蓟马 (*Thrips palmi*) 和烟蓟马 (*Thrips tabaci*);

[0282] 膜翅目 (Hymenoptera), 例如菜叶蜂 (*Athalia rosae*), *Atta cephalotes*, 切叶蚁 (*Atta sexdens*), 德州切叶蚁 (*Atta texana*), 李实叶蜂 (*Hoplocampa minuta*), 苹实叶蜂 (*Hoplocampa testudinea*), 小家蚁 (*Monomorium pharaonis*), 火蚁 (*Solenopsis geminata*) 和阿根廷火蚁 (*Solenopsis invicta*);

[0283] 半翅目 (Heteroptera), 例如喜绿蝽 (*Acrosternum hilare*), 麦长蝽 (*Blissus leucopterus*), 烟草黑斑盲蝽 (*Cyrtopeltis notatus*), 棉红蝽 (*Dysdercus cingulatus*), 中间棉红蝽 (*Dysdercus intermedius*), 小麦盾蝽 (*Eurygaster integriceps*), 棉褐蝽 (*Euschistus impictiventris*), 叶足缘蝽 (*Leptoglossus phyllopus*), 美国牧草盲蝽 (*Lygus lineolaris*), 牧草盲蝽 (*Lygus pratensis*), 稻绿蝽 (*Nezara viridula*), 方背皮蝽 (*Piesma quadrata*), 岛稻蝽 (*Solubea insularis*) 和 *Thyanta perditor*;

[0284] 同翅目 (Homoptera), 例如驴豆无网蚜 (*Acyrtosiphon onobrychis*), 落叶松球蚜 (*Adelges laricis*), *Aphidula nasturtii*, 豆卫矛蚜 (*Aphis fabae*), 草莓根蚜 (*Aphis forbesi*), 苹果蚜 (*Aphis pomi*), 棉蚜 (*Aphis gossypii*), 醋栗蚜 (*Aphis grossulariae*), 茶藨蚜 (*Aphis schneideri*), 异绣线菊蚜 (*Aphis spiraeicola*), 接骨木蚜 (*Aphis sambuci*), 豌豆蚜 (*Acyrtosiphon pisum*), 土豆沟无网蚜 (*Aulacorthum solani*), 蓟短尾蚜 (*Brachycaudus cardui*), 李短尾蚜 (*Brachycaudus helichrysi*), 桃短尾蚜 (*Brachycaudus persicae*), 杏短尾蚜 (*Brachycaudus prunicola*), 甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*), 角毛蚜 (*Capitophorus horni*), *Cerosipha gossypii*, 草莓中瘤钉毛蚜 (*Chaetosiphon fragaefolii*), 茶藨隐瘤蚜 (*Cryptomyzus ribis*), 银枞迁移球蚜 (*Dreyfusia nordmannianae*), 云杉锥球蚜 (*Dreyfusia piceae*), 根西圆尾蚜 (*Dysaphis radicola*), *Dysaulacorthum pseudosolani*, 车前西圆尾蚜 (*Dysaphis plantaginea*), 梨西圆尾蚜属 (*Dysaphis pyri*), 蚕虫小绿叶蝉 (*Empoasca fabae*), 梅大尾蚜 (*Hyalopterus pruni*), 茶藨苦菜蚜 (*Hyperomyzus lactucae*), 麦长管蚜 (*Macrosiphum avenae*), 马铃薯长管蚜 (*Macrosiphum euphorbiae*), *Macrosiphon rosae*, 巢菜修尾蚜 (*Megoura viciae*), *Melanaphis pyramis*, 麦无网蚜 (*Metopolophium dirhodum*), 桃蚜 (*Myzus persicae*), 冬葱瘤蚜 (*Myzus ascalonicus*), 樱桃瘤蚜 (*Myzus cerasi*), 黄药子瘤蚜 (*Myzus varians*), 莴苣蓇长管蚜 (*Nasonovia ribis-nigri*), 褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*), 柄蓇绵蚜 (*Pemphigus bursarius*), 甘蔗扁角飞虱 (*Perkinsiella saccharicida*), 忽布疣蚜 (*Phorodon humuli*), 苹木虱 (*Psylla mali*), 梨木虱 (*Psylla pyri*), 冬葱缢瘤蚜 (*Rhopalomyzus ascalonicus*), 玉米缢管蚜 (*Rhopalosiphum maidis*),

禾谷缢管蚜 (*Rhopalosiphum padi*), 苹果缢管蚜 (*Rhopalosiphum insertum*), 颊圆尾蚜 (*Sappaphis mala*), 苹圆尾蚜 (*Sappaphis mali*), 麦二叉蚜 (*Schizaphis graminum*), 榆梨绵蚜 (*Schizoneura lanuginosa*), 麦长管蚜 (*Sitobion avenae*), 温室粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*), 橘声蚜 (*Toxoptera aurantii*), 和葡萄根瘤蚜 (*Viteus vitifolii*);

[0285] 等翅目 (Isoptera), 例如榆木白蚁 (*Calotermes flavicollis*), *Leucotermes flavipes*, 暗黑散白蚁 (*Reticulitermes lucifugus*) 和柑橘白蚁 (*Termes natalensis*);

[0286] 直翅目 (Orthoptera), 例如家蟋 (*Acheta domestica*), 东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*), 德国小蠊 (*Blattella germanica*), 木耳球螋 (*Forficula auricularia*), 欧洲蝼蛄 (*Gryllotalpa gryllotalpa*), 亚洲飞蝗 (*Locusta migratoria*), 双带黑蝗 (*Melanoplus bivittatus*), 赤胫黑蝗 (*Melanoplus femur-rubrum*), 墨西哥黑蝗 (*Melanoplus mexicanus*), 血黑蝗 (*Melanoplus sanguinipes*), 石枯黑蝗 (*Melanoplus spretus*), 红蝗 (*Nomadacris septemfasciata*), 美洲大蠊 (*Periplaneta americana*), 美洲沙漠蝗 (*Schistocerca americana*), 外来沙漠蝗 (*Schistocerca peregrina*), *Stauronotus maroccanus* 和温室沙螽 (*Tachycines asynamorus*);

[0287] 蛛形纲 (Arachnoidea), 比如蜱螨目 (Acarina), 例如软蜱科 (Argasidae), 硬蜱科 (Ixodidae) 和疥螨科 (Sarcoptidae) 各科, 比如美洲花蜱 (*Amblyomma americanum*), 杂色花蜱 (*Amblyomma variegatum*), 波斯锐缘蜱 (*Argas persicus*), 具环牛蜱 (*Boophilus annulatus*), 消色牛蜱 (*Boophilus decoloratus*), 微小牛蜱 (*Boophilus microplus*), 森林革蜱 (*Dermacentor silvarum*), 截形璃眼蜱 (*Hyalomma truncatum*), 蓖子硬蜱 (*Ixodes ricinus*), 红硬蜱 (*Ixodes rubicundus*), 毛白钝缘蜱 (*Ornithodoros moubata*), 耳残喙蜱 (*Otobius megnini*), 鸡皮刺螨 (*Dermanyssus gallinae*), 绵羊痒螨 (*Psoroptes ovis*), 非洲扇头蜱 (*Rhipicephalus appendiculatus*), 外翻扇头蜱 (*Rhipicephalus evertsi*), 人疥螨 (*Sarcoptes scabiei*), 和瘰螨科的种 (*Eriophyidae* spp.), 比如斯氏针刺瘰螨 (*Aculus schlechtendali*), 桔锈螨 (*Phyllocoptrata oleivora*) 和桔瘤瘰螨 (*Eriophyes sheldoni*); 跗线螨科的种 (*Tarsonemidae* spp.), 比如樱草植食螨 (*Phytonemus pallidus*) 和侧多食跗线螨 (*Polyphagotarsonemus latus*); 细须螨科的种 (*Tenuipalpidae* spp.), 比如枣短须螨 (*Brevipalpus phoenicis*); 叶螨科的种 (*Tetranychidae* spp.), 比如朱砂叶螨 (*Tetranychus cinnabarinus*), 茶红叶螨 (*Tetranychus kanzawai*), 太平洋叶螨 (*Tetranychus pacificus*), 普通叶螨 (*Tetranychus telarius*) 和二斑叶螨 (*Tetranychus urticae*), 苹果全爪螨 (*Panonychus ulmi*), 柑橘全爪螨 (*Panonychus citri*), 和草地小爪螨 (*Oligonychus pratensis*); 以及

[0288] 线虫, 包括植物寄生线虫和土栖线虫。植物寄生线虫包括, 比如根结线虫, 北方根结线虫 (*Meloidogyne hapla*), 南方根结线虫 (*Meloidogyne incognita*), 爪哇根结线虫 (*Meloidogyne javanica*), 和其它根结线虫属 (*Meloidogyne*) 物种; 孢囊-形成线虫, 马铃薯金线虫 (*Globodera rostochiensis*) 和其它球异皮线虫属 (*Globodera*) 物种; 燕麦异皮线虫 (*Heterodera avenae*), 大豆异皮线虫 (*Heterodera glycines*), 甜菜异皮线虫 (*Heterodera schachtii*), 三叶草异皮线虫 (*Heterodera trifolii*), 和其它异皮线虫属 (*Heterodera*) 物种; 种瘿线虫, 瘿线虫属 (*Anguina*) 物种; 茎叶线虫, 滑刃线虫属 (*Aphelenchoides*) 物种; 刺线虫, 长尾刺线虫 (*Belonolaimus longicaudatus*) 和其它刺线

虫属 (*Belonolaimus*) 物种 ; 松线虫, 嗜木伞滑刃线虫 (*Bursaphelenchus xylophilus*) 和其它伞滑刃线虫属 (*Bursaphelenchus*) 物种 ; 环线虫, 环线虫属 (*Criconema*) 物种, 小环线虫属 (*Criconemella*) 物种, 轮线虫属 (*Criconemoides*) 物种, 间环线虫属 (*Mesocriconema*) 物种 ; 茎干和鳞茎线虫, 烂茎线虫 (*Ditylenchus destructor*), 起绒草茎线虫 (*Ditylenchus dipsaci*) 和其它茎线虫属 (*Ditylenchus*) 物种 ; 锥线虫, 锥线虫属 (*Dolichodorus*) 物种 ; 螺旋线虫, 香蕉螺旋线虫 (*Helicotylenchus multicinctus*) 和其它螺旋线虫属 (*Helicotylenchus*) 物种 ; 鞘线虫和拟鞘线虫, 鞘线虫属 (*Hemicyclophora*) 物种和半轮线虫属 (*Hemicriconemoides*) 物种 ; 潜根线虫属 (*Hirshmanniella*) 物种 ; 纽带线虫, 纽带线虫属 (*Hoploaimus*) 物种 ; 伪根结线虫, 真珠线虫属 (*Nacobbus*) 物种 ; 长针线虫, 逸去长针线虫 (*Longidorus elongatus*) 和其它长针线虫属 (*Longidorus*) 物种 ; 针线虫, 针线虫属 (*Paratylenchus*) 物种 ; 根痕线虫, 落选短体线虫 (*Pratylenchus neglectus*), 穿刺短体线虫 (*Pratylenchus penetrans*), 弯短体线虫 (*Pratylenchus curvatus*), 斑叶兰短体线虫 (*Pratylenchus goodeyi*) 和其它短体线虫属 (*Pratylenchus*) 物种 ; 潜伏线虫, 相似穿孔线虫 (*Radopholus similis*) 和其它穿孔线虫属 (*Radopholus*) 物种 ; 肾形线虫, 强壮盘旋线虫 (*Rotylenchus robustus*) 和其它盘旋线虫属 (*Rotylenchus*) 物种 ; 盾状线虫属 (*Scutellonema*) 物种 ; 短根线虫, 原始毛刺线虫 (*Trichodorus primitivus*) 和其它毛刺线虫属 (*Trichodorus*) 物种, 类毛刺线虫属 (*Paratrachodorus*) 物种 ; 矮化线虫, 克莱顿矮化线虫 (*Tylenchorhynchus claytoni*), 不定矮化线虫 (*Tylenchorhynchus dubius*) 和其它矮化线虫属 (*Tylenchorhynchus*) 物种 ; 柑桔线虫, 小垫刃线虫属 (*Tylenchulus*) 物种 ; 剑线虫, 剑线虫属 (*Xiphinema*) 物种 ; 和其它植物寄生线虫物种。

[0289] 所述式 I 化合物和含有它们的组合物, 还能够用于杀软体动物作用, 特别是对抗蛞蝓。可以通过本发明方法和组合物防治的软体动物优选是腹足纲中包括的那些软体动物, 更优选肺螺亚纲, 甚至更优选蜗牛和蛞蝓, 而最优选包括, 例如瓶螺科 (*Ampullariidae*) ; 阿勇蛞蝓属 (*Arion*) (灰黑阿勇蛞蝓 (*A. ater*), 环斑阿勇蛞蝓 (*A. circumscriptus*), 庭院阿勇蛞蝓 (*A. hortensis*), 红棕阿勇蛞蝓 (*A. rufus*)) ; 巴蜗牛科 (*Bradybaenidae*) (灌木巴蜗牛 (*Bradybaena fruticum*)) ; 蜗牛属 (*Cepaea*) (庭院蜗牛 (*C. hortensis*), 森林蜗牛 (*C. Nemoralis*)) ; *ochlodina* ; 灰蛞蝓属 (*Deroceras*) (野灰蛞蝓 (*D. agrestis*), *D. empiricorum*, 田灰蛞蝓 (*D. laeve*), 庭园灰蛞蝓 (*D. reticulatum*)) ; *Discus* (*D. rotundatus*) ; *Euomphalia* ; 土蜗属 (*Galba*) (截形土蜗 (*G. trunculata*)) ; 小蜗牛属 (*Helicelia*) (伊塔拉小蜗牛 (*H. itala*), 布维小蜗牛 (*H. obvia*)) ; 大蜗牛科 (*Helicidae*) (*Helicigona arbustorum*) ; *Helicodiscus* ; 大蜗牛属 (*Helix*) (开放大蜗牛 (*H. aperta*)) ; 蛞蝓属 (*Limax*) (灰黑蛞蝓 (*L. cinereoniger*), 黄蛞蝓 (*L. flavus*), 边缘蛞蝓 (*L. marginatus*), 大蛞蝓 (*L. maximus*), 柔蛞蝓 (*L. tenellus*)) ; 椎实螺属 (*Lymnaea*) ; *Milax* (温室蛞蝓 (*M. gagates*), *M. marginatus*, *M. sowerbyi*) ; 钻螺属 (*Opeas*) ; 福寿螺属 (*Pomacea*) (小管福寿螺 (*P. canaticulata*)) ; 瓦娄蜗牛属 (*Vallonia*) 和仿带螺属 (*Zanitoides*)。根据本发明的组合尤其有效地对抗灰蛞蝓属 (*Deroceras*), 比如庭园灰蛞蝓 (*Deroceras reticulatum*)。

[0290] 所述式 I 化合物和含有它们的组合物, 对昆虫和 / 或线虫的防治特别有用。尤其是, 所述式 I 化合物 (特别是表 1.1-1.60 中公开的那些) 和含有它们的组合物, 能

够对防治选自同翅目 (Homoptera), 鳞翅目 (Lepidoptera), 双翅目 (Diptera), 缨翅目 (Thysanoptera) 各目, 和 / 或线虫纲 (Nematoda) 的病虫害特别有用。

[0291] 在本发明的优选实施方式中, 所述式 I 化合物 (比如表 1.1-1.60 中公开的那些) 及其组合物可用于防治昆虫或蛛形动物, 尤其是鳞翅目 (Lepidoptera)、缨翅目 (Thysanoptera)、鞘翅目 (Coleoptera) 和 / 或同翅目 (Homoptera) 各目的昆虫和蜱螨目 (Acarina) 的蛛形动物。

[0292] 根据本发明的式 I 化合物 (有利地, 表 1.1-1.60 中公开的那些) 及其组合物可以特别地用于防治鳞翅目 (Lepidoptera)、鞘翅目 (Coleoptera)、缨翅目 (Thysanoptera)、同翅目 (Homoptera) 各目的昆虫, 和蜱螨目 (Acarina) 的蛛形动物, 比如实夜蛾属 (*Heliothis* spp.)、蓟马属 (*Thrips* spp.)、叶甲属 (*Diabrotica* spp.)、瘤蚜属 (*Myzus* spp.)、蚜属 (*Aphis* spp.)、贪夜蛾属 (*Spodoptera* spp.)、菜蛾属 (*Plutella* spp.) 和叶螨科的种 (*Tetranychidae* spp.)。

[0293] 在又一方面中, 本发明涉及在植物保护中防治病虫害或者保护种子、植物、在之后的时间点生长的植物器官和 / 或植物部分对抗病虫害损害的方法, 其包括将如前文所定义的式 I 化合物或其组合物施用至所述病虫害, 至所述植物, 至所述种子, 至所述植物部分和 / 或植物器官和 / 或其各自的环境。

[0294] 为了用于根据本发明的方法中, 所述式 I 化合物可以转化为惯用的配制剂, 例如溶液剂, 乳剂, 悬浮剂, 尘剂, 粉剂, 糊剂, 颗粒剂和可直接喷雾的溶液剂。所述使用形式取决于具体目的和施用方法。选择配制剂和施用方法以保证在各情况下根据本发明的式 I 化合物细分且均匀地分布。

[0295] 所述配制剂是以已知方式制备的 (参见例如综述 US 3,060,084, EP-A 707445 (关于液态浓缩物), Browning, " Agglomeration ", Chemical Engineering, 12 月 4 日, 1967, 147-48, Perry ' s Chemical Engineer ' s Handbook, 第四版, McGraw-Hill, New York, 1963, 8-57 页以及下述 WO 91/13546, US 4,172,714, US 4,144,050, US3,920,442, US 5,180,587, US 5,232,701, US 5,208,030, GB2,095,558, US 3,299,566, Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, Hance 等人, Weed Control Handbook, 第八版, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 和 Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Germany), 2001, 2. D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN0-7514-0443-8)), 例如通过用适用于配制农业化学品的惯用配制助剂, 比如溶剂和 / 或载体, 任选的乳化剂, 表面活性剂和分散剂, 防腐剂, 消泡剂, 防冻剂, 对于种子处理配制剂还任选着色剂和 / 或粘合剂和 / 或胶凝剂来拓展所述式 I 化合物。

[0296] 适宜的溶剂 / 载体是例如:

[0297] - 溶剂, 比如水, 芳族溶剂 (例如 Solvesso 产品, 二甲苯等), 烷烃 (例如矿物馏分), 醇 (例如甲醇, 丁醇, 戊醇, 苄基醇), 酮 (例如环己酮, γ -丁内酯), 吡咯烷酮 (N-甲基-吡咯烷酮 (NMP), N-辛基吡咯烷酮 NOP), 乙酸酯 (乙二醇二乙酸酯), 乳酸烷基酯, 内酯比如 γ -丁内酯, 乙二醇, 脂肪酸二甲基酰胺, 脂肪酸和脂肪酸酯, 甘油三酯, 植物或动物来源的油和改性油比如烷基化的植物油。原则上还可以使用溶剂混合物。

[0298] - 载体比如磨碎的天然矿物和磨碎的合成矿物, 比如硅胶, 细分的硅酸, 硅酸盐, 滑石, 高岭土, 镁质粘土, 石灰石, 石灰, 白垩, 红玄武土, 黄土, 粘土, 白云石, 硅藻土, 硫酸钙和硫酸镁, 氧化镁, 磨碎的合成材料, 肥料, 比如, 例如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、脲和植物来源的产品, 比如谷物粉、树皮粉、木粉和坚果壳粉、纤维素粉末和其它固体载体。

[0299] 适宜的乳化剂是非离子和阴离子乳化剂 (例如聚氧亚乙基脂肪醇醚, 烷基磺酸盐和芳基磺酸盐)。

[0300] 分散剂的实例是木质素 - 亚硫酸废液和甲基纤维素。

[0301] 适宜的表面活性剂是下述酸的碱金属、碱土金属和铵盐: 木质素磺酸, 萘磺酸, 苯酚磺酸, 二丁基萘磺酸, 烷基芳基磺酸盐, 烷基硫酸盐, 烷基磺酸盐, 脂肪醇硫酸盐, 脂肪酸和硫酸化的脂肪醇乙二醇醚, 以及磺化的萘和萘衍生物与甲醛的缩合物, 萘或萘磺酸与苯酚和甲醛的缩合物, 聚氧亚乙基辛基苯基醚, 乙氧基化的异辛基苯酚, 辛基苯酚, 壬基苯酚, 烷基苯基聚乙二醇醚, 三丁基苯基聚乙二醇醚, 三硬脂基苯基聚乙二醇醚, 烷基芳基聚醚醇, 醇和脂肪醇 / 环氧乙烷缩合物, 乙氧基化的蓖麻油, 聚氧亚乙基烷基醚, 乙氧基化的聚氧丙烯, 月桂醇聚乙二醇醚缩醛, 山梨糖醇酯。

[0302] 还可以将防冻剂比如甘油, 乙二醇, 丙二醇和杀菌剂加入配制剂。

[0303] 适宜的消泡剂是例如基于硅或硬脂酸镁的消泡剂。

[0304] 适宜的防腐剂是例如双氯酚和苄基醇半缩甲醛。

[0305] 适宜的增稠剂是赋予所述配制剂假塑性流动行为的化合物, 所述行为即静止时高粘度而在搅拌阶段下低粘度。在此范畴中可以提及, 例如, 基于多糖的商业化增稠剂, 比如黄原胶® (Kelco 的 **Kelzan®**), **Rhodopol®23** (Rhône Poulenc) 或 **Veegum®** (来自 RT. Vanderbilt), 或有机层状硅酸盐, 比如 **Attaclay®** (来自 Engelhardt)。

[0306] 适宜用于本发明分散液的消泡剂是, 例如, 硅酮乳液 (比如, 例如, **Silikon®SRE**, Wacker 或 **Rhodorsil®**, 来自 Rhodia), 长链醇, 脂肪酸, 有机氟化合物及其混合物。

[0307] 可以加入杀生物剂以稳定根据本发明的组合物对抗微生物侵袭。

[0308] 适宜的杀生物剂是, 例如基于异噻唑酮的那些, 比如以商标 Avecia (或 Arch) 的 **Proxel®** 或 Thor Chemie 的 **Acticide®RS** 和 Rohmand Haas 的 **Kathon®MK** 销售的化合物。

[0309] 适宜的防冻剂是有机多元醇, 例如乙二醇, 丙二醇或甘油。它们通常以按活性化合物组合物的总重量计不超过 10% 重量的量应用。

[0310] 如果合适, 根据本发明的活性化合物组合物可以包含按所制配制剂的总量计 1 至 5% 重量的缓冲剂来调节 pH, 所用缓冲剂的量和类型取决于活性化合物或各活性化合物的化学特性。缓冲剂的实例是无机或有机弱酸的碱金属盐, 所述弱酸是比如例如, 磷酸, 硼酸, 乙酸, 丙酸, 柠檬酸, 富马酸, 酒石酸, 草酸和琥珀酸。

[0311] 适宜于制备可直接喷雾的溶液剂、乳剂、糊剂或油分散剂的物质是中到高沸点的矿物油馏分, 比如煤油或柴油, 还有煤焦油和植物或动物来源的油, 脂族、环状和芳族烃, 例如甲苯、二甲苯、烷烃、四氢萘、烷基化的萘或它们的衍生物, 甲醇, 乙醇, 丙醇, 丁醇, 环己醇, 环己酮, 异佛尔酮, 强极性溶剂, 例如二甲亚砜、N-甲基吡咯烷酮和水。

[0312] 粉剂、散布材料和尘剂能够这样制备: 混合活性物质或将活性物质与固体载体一

起研磨。

[0313] 颗粒剂,例如包衣颗粒剂、浸渍颗粒剂和均质颗粒剂,能够这样制备:将活性成分结合至固体载体。固体载体的实例是矿物土,比如硅胶,硅酸盐,滑石,高岭土,镁质粘土(attaclay),石灰石,石灰,白垩,红玄武土,黄土,粘土,白云石,硅藻土,硫酸钙,硫酸镁,氧化镁,磨碎的合成材料,肥料,比如例如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、脲,和植物来源的产品,比如谷物粉,树皮粉,木粉和坚果壳粉,纤维素粉末和其它固体载体。

[0314] 通常,所述配制剂包含 0.01 至 95%重量,优选 0.1 至 90%重量的活性成分。以 90%至 100%,优选 95%至 100%(根据 NMR 谱)的纯度应用所述活性成分。

[0315] 为了种子处理目的各配制剂可被稀释 2-10 倍,这导致即用制剂中活性化合物的浓度为 0.01 至 60%重量,优选 0.1 至 40%重量。

[0316] 所述式 I 化合物能够通过喷雾、雾化、喷粉、散布或浇注以下述形式使用:原样,它们的配制剂形式或由其制备的使用形式,例如可直接喷雾的溶液剂、粉剂、悬浮剂或分散剂、乳剂、油分散剂、糊剂、粉剂产品、散布材料或颗粒剂形式。所述使用形式完全取决于预计目的;它们意在保证在各情况下活性化合物尽可能细分的分布。

[0317] 含水使用形式能够通过加水制备自乳液浓缩物,糊剂或可湿性粉剂(可喷雾粉剂、油分散液)。为了制备乳液、糊剂或油分散剂,原样或溶于油或溶剂的物质能够借助润湿剂、增粘剂、分散剂或乳化剂在水中匀化。另选地,可以制备活性物质、润湿剂、增粘剂、分散剂或乳化剂,和合适时,溶剂或油构成的浓缩物,且这种浓缩物适宜于用水稀释。

[0318] 所述即用产品中的活性成分浓度能够在相对宽的范围变化。通常,其是 0.0001 至 10%,优选 0.01 至 1%重量。所述活性成分还可以成功地用于超低容量剂方法(ULV),其可以施用包含超过 95%重量活性成分的配制剂,或者甚至施用不含添加剂的活性成分。

[0319] 下文为配制剂的实例:

[0320] 1. 用于用水稀释的产品。为种子处理目的,可以将这种产品稀释或未稀释地施用于种子。

[0321] A) 水-可溶液剂(SL, LS)

[0322] 将 10 份重量的活性化合物溶于 90 份重量的水或水-可溶性溶剂。作为替代,加入润湿剂或其它辅剂。所述活性化合物在用水稀释时溶解,这样获得含 10%(w/w)活性化合物的配制剂。

[0323] B) 可分散液剂(DC)

[0324] 将 20 份重量的活性化合物溶于 70 份重量的环己酮,加入 10 份重量的分散剂,例如聚乙烯吡咯烷酮。用水稀释提供分散液,这样获得含 20%(w/w)活性化合物的配制剂。

[0325] C) 乳油(EC)

[0326] 将 15 份重量的活性化合物溶于 7 份重量的二甲苯,加入十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物(在各情况下为 5 份重量)。用水稀释提供乳液,这样获得含 15%(w/w)活性化合物的配制剂。

[0327] D) 乳液(EW, EO, ES)

[0328] 将 25 份重量的活性化合物溶于 35 份重量的二甲苯,加入十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物(在各情况下 5 份重量)。借助乳化机(例如 Ultraturrax)将此混合物引入 30 份重量的水并制成均质乳液。用水稀释提供乳液,这样获得含 25%(w/w)活性化合物

的配制剂。

[0329] E) 悬浮液 (SC, OD, FS)

[0330] 在搅动的球磨机中,碎化 20 份重量的活性化合物,加入 10 份重量的分散剂、润湿剂和 70 份重量的水或有机溶剂,提供细分的活性化合物悬浮液。用水稀释提供活性化合物的稳定悬浮液,这样获得含 20% (w/w) 活性化合物的配制剂。

[0331] F) 水-可分散性粒剂和水-可溶性颗粒剂 (WG, SG)

[0332] 细磨 50 份重量的活性化合物,加入 50 份重量的分散剂和润湿剂,并且借助技术设备(例如挤出,喷雾塔,流化床)制成水-可分散性或水-可溶性颗粒剂。用水稀释提供活性化合物的稳定分散液或溶液,这样获得含 50% (w/w) 活性化合物的配制剂。

[0333] G) 水-可分散性粉剂和水-可溶性粉剂 (WP, SP, SS, WS)

[0334] 在转子-定子磨中研磨 75 份重量的活性化合物,加入 25 份重量的分散剂、润湿剂和硅胶。用水稀释提供活性化合物的稳定分散液或溶液,这样获得含 75% (w/w) 活性化合物的配制剂。

[0335] H) 凝胶-配制剂 (GF)

[0336] 在搅动的球磨机中,碎化 20 份重量的活性化合物,加入 10 份重量的分散剂,1 份重量的胶凝剂润湿剂和 70 份重量的水或有机溶剂,提供细分的活性化合物悬浮液。用水稀释提供活性化合物的稳定悬浮液,这样获得含 20% (w/w) 活性化合物的配制剂。

[0337] 2. 用于叶面施用的未稀释地施用的产品。为种子处理目的,这种产品可以稀释地或未稀释地施用至种子。

[0338] I) 粉剂 (DP, DS)

[0339] 细磨 5 份重量的活性化合物并与 95 份重量细分的高岭土密切混合。这提供具有 5% (w/w) 活性化合物的耐久产品。

[0340] J) 颗粒剂 (GR, FG, GG, MG)

[0341] 细磨 0.5 份重量的活性化合物并与 95.5 份重量的载体联合,这样获得含 0.5% (w/w) 活性化合物的配制剂。当前的方法是挤出,喷雾干燥或流化床。这提供用于叶面的未稀释地施用的颗粒剂。

[0342] K) ULV 溶液剂 (UL)

[0343] 将 10 份重量的活性化合物溶于 90 份重量的有机溶剂,例如二甲苯。这提供具有 10% (w/w) 活性化合物的产品,未稀释地将其施用用于叶面用途。

[0344] 因此,配制剂形式的组合物包含如第一方面中所定义的式 I 化合物并且本文还提供一种或多种惯用的配制剂惰性物质;特别优选种子处理组合物。

[0345] 可以将各种类型的油、润湿剂、助剂、除草剂、杀真菌剂、其它农药或杀细菌剂加入本发明的化合物,如果合适在即将使用之前(桶混)加入。这些试剂通常与根据本发明的试剂以 1:10 至 10:1 的重量比混合。

[0346] 在又一方面中,本发明涉及组合物,其包含如前文所定义的式 I 化合物和一种或多种惯用的配制剂辅剂。

[0347] 在又一方面中,本发明涉及组合物,其包含如前文所定义的式 I 化合物和一种或多种活性成分,和任选地一种或多种惯用的配制剂辅剂。

[0348] 所述式 I 化合物及其组合物可以与其它活性成分一起施用,所述其它活性成分是

例如其它农药,杀昆虫剂,杀真菌剂,除草剂,肥料比如硝酸铵、脲、钾碱和过磷酸盐,植物毒素和植物生长调节剂,安全剂和杀线虫剂。这些额外成分可以与上文描述的活性成分按顺序使用或组合使用,如果合适仅在即将使用之前添加(桶混)或者提供为经制剂的产品(预混)。例如,可以在用其它活性成分处理之前或之后用包含式 I 化合物的组合物来喷雾植物。通常在种子处理施用中将包括式 I 化合物的活性成分的组合用作桶混或预混组合物。

[0349] 各额外活性成分能够与式 I 化合物以 1 : 10 至 10 : 1 的重量比混合。在两种或多种额外活性成分和式 I 化合物的情况下,任意两种活性成分(包括式 I)的化合物可以呈 1 : 10 至 10 : 1 的重量比。所得组合物常常引起更宽的农药作用谱。

[0350] 根据本发明的所述式 I 化合物能够与其一起使用并且与其一起可以产生潜在增效效果的农药的下述列表(M&F)意在说明可能的组合,而不是强加任何限制:

[0351] M. 1. 有机(硫代)磷酸酯类:乙酰甲胺磷,甲基吡啶磷,保棉磷,毒死蜱,甲基毒死蜱,毒虫畏,二嗪磷,敌敌畏,百治磷,乐果,乙拌磷,乙硫磷,杀螟硫磷,倍硫磷,噁唑磷,马拉硫磷,甲胺磷,杀扑磷,甲基-对硫磷,速灭磷,久效磷,亚砷磷,paraoxon,对硫磷,稻丰散,伏杀硫磷,亚胺硫磷,磷胺,甲拌磷,辛硫磷,甲基嘧啶磷,丙溴磷,丙硫磷,硫丙磷,杀虫畏,特丁硫磷,三唑磷,敌百虫;

[0352] M. 2. 氨基甲酸酯类:棉铃威,涕灭威,噁虫威,丙硫克百威,甲萘威,克百威,丁硫克百威,苯氧威,呋线威,甲硫威,灭多威,杀线威,抗蚜威,残杀威,硫双威,唑蚜威;

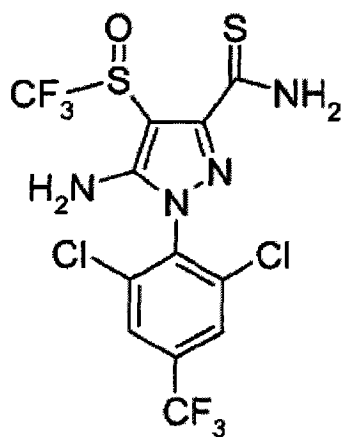
[0353] M. 3. 拟除虫菊酯(Pyrethroids):烯丙菊酯,联苯菊酯,氟氯氰菊酯,氯氟氰菊酯,苯醚氰菊酯,氯氰菊酯, α -氯氰菊酯,高效氯氰菊酯, ζ -氯氰菊酯,溴氰菊酯,右旋烯炔菊酯,S-氰戊菊酯,醚菊酯,甲氰菊酯,氰戊菊酯,炔咪菊酯, λ -氯氟氰菊酯,氯菊酯,炔丙菊酯,除虫菊素 I 和 II,苄呋菊酯,氟硅菊酯, τ -fluvalinate,七氟菊酯,胺菊酯,四溴菊酯,四氟苯菊酯,profluthrin,四氟甲醚菊酯;

[0354] M. 4. 生长调节剂:a) 几丁质合成抑制剂:苯甲酰脲:氟啶脲,除虫脲,氟环脲,氟虫脲,氟铃脲,虱螨脲,氟酰脲,氟苯脲,杀铃脲;噻嗪酮,苯虫醚,噻螨酮,乙螨唑,四螨嗪;b) 蜕皮激素拮抗剂:氯虫酰肼,甲氧虫酰肼,虫酰肼,印楝素;c) 保幼激素类似物:吡丙醚,烯虫酯,苯氧威;d) 脂类生物合成抑制剂:螺螨酯,spiromesifen,螺虫乙酯;

[0355] M. 5. 烟碱受体激动剂/拮抗剂化合物:噻虫胺,呋虫胺,吡虫啉,噻虫嗪,烯啶虫胺,啉虫脒,噻虫啉和 AKD-1022;

[0356] M. 6. GABA 拮抗剂化合物:acetoprole,硫丹,乙虫腈,氟虫腈,vaniliprole,pyrafluprole,pyriprole,式 I² 的苯基吡唑化合物

[0357]

(I²);

[0358] M. 7. 大环内酯杀昆虫剂:阿维菌素,甲氨基阿维菌素, milbemectin, lepimectin, 多杀霉素;

[0359] M. 8. METI I 化合物:啞螨醚,啞螨灵,吡螨胺, tolfenpyrad, flufenerim;

[0360] M. 9. METI II 和 III 化合物:acequinocyl, fiuacyprim, 氟蚁腓;

[0361] M. 10. 解偶联剂化合物:虫螨腈;

[0362] M. 11. 氧化磷酸化抑制剂化合物:三环锡,丁醚脲,苯丁锡,炔螨特;

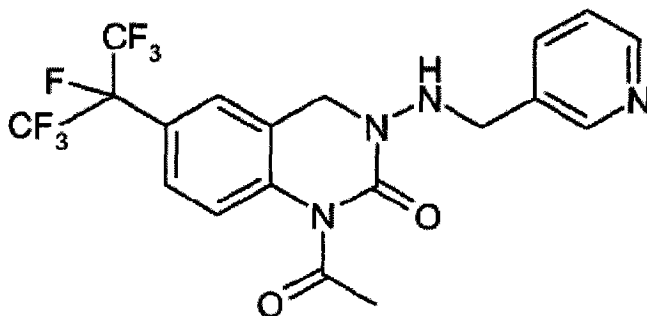
[0363] M. 12. 蜕皮干扰物质化合物:灭蝇胺;

[0364] M. 13. 混合功能氧化酶抑制剂化合物:胡椒基丁醚;

[0365] M. 14. 钠通道封闭化合物:茚虫威,氰氟虫腓;

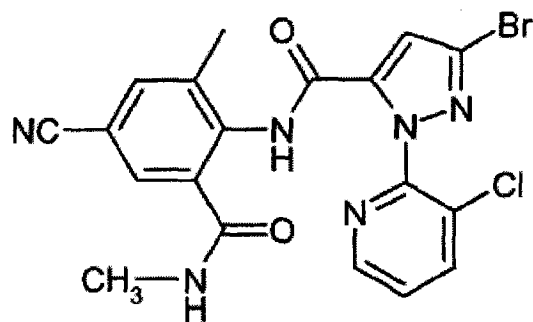
[0366] M. 15. 其它各类:双甲脒, benclothiaz, 联苯肼酯, 杀螟丹, 氟烟胺, pyridalyl, 吡蚜酮, 硫磺, 杀虫环, 氟苯虫酰胺, cyenopyrafen, 吡氟硫磷, 丁氟螨酯, amidoflumet, pyrifluquinazon, 式 I³ 的氨基啉啉酮化合物

[0367]

(I³);

[0368] N-R' -2,2-二卤代-1-R'' 环-丙烷甲酰胺-2-(2,6-二氯- α , α , α -三氟-对-甲苯基) 胺或 N-R' -2,2-二(R''') 丙酰胺-2-(2,6-二氯- α , α , α -三氟-对-甲苯基)-胺, 其中 R' 是甲基或乙基, 卤代是氯或溴, R'' 是氢或甲基和 R''' 是甲基或乙基; 邻氨基苯甲酰胺化合物, 比如氯虫苯甲酰胺或所述式 I⁴ 的化合物

[0369]

(I⁴);

[0370] 丙二腈化合物,如 JP 2002284608, WO 02/89579, W002/90320, WO 02/90321, WO 04/06677, WO 04/20399, JP 200499597, WO 05/68423, WO 05/68432,或 WO 05/63694 中的描述,特别是丙二腈化合物 CF₃(CH₂)₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H,

[0371] CF₃(CH₂)₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₅CF₂H,

[0372] CF₃(CH₂)₂C(CN)₂(CH₂)₂C(CF₃)₂F,

[0373] CF₃(CH₂)₂C(CN)₂(CH₂)₂(CF₂)₃CF₃,

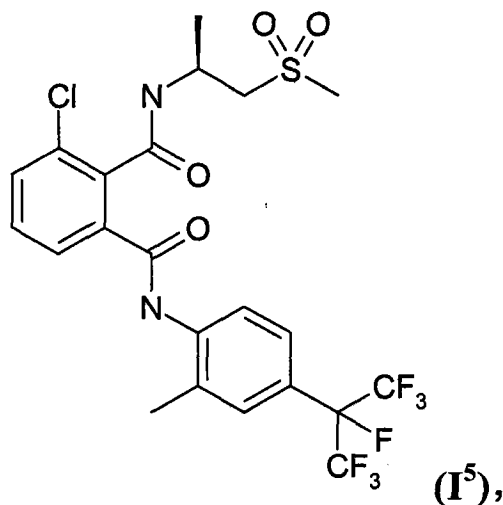
[0374] CF₂H(CF₂)₃CH₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H,

[0375] CF₃(CH₂)₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₃,

[0376] CF₃(CF₂)₂CH₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H,和

[0377] CF₃CF₂CH₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H;和式 I⁵ 的化合物

[0378]

(I⁵),

[0379] 如 W007/101601 中所描述。

[0380] 组 M 的可商购化合物可以在尤其是 The Pesticide Manual,第十三版, British Crop Protection Council(2003) 的公开中找到。

[0381] 式 I² 硫代酰胺及其制备已描述于 WO 98/28279 中。Lepimectin 已知自 Agro Project, PJB Publications Ltd, 2004 年 11 月。Benclothiaz 及其制备已描述于 EP-A1454621 中。杀扑磷和 Paraoxon 及其制备已描述于 Farm Chemicals Handbook, 第 88 卷, Meister Publishing Company, 2001 及其制备。Acetoprole 及其制备已描述于 W098/28277 及其制备。氰氟虫腈及其制备已描述于 EP-A1462456 及其制备。吡氟硫磷已描述于 Pesticide Science 54, 1988, 第 237-243 页和 US 4822779 中。Pyrafluprole 及其制备已描述于 JP 2002193709 和 W001/00614 中。Pyriprole 及其制备已描述于 WO

98/45274 和 US 6335357 中。Amidoflumet 及其制备已描述于 US 6221890 和 JP 21010907 中。Flufenimer 及其制备已描述于 WO 03/007717 和 WO 03/007718 中。丁氟螨酯及其制备已描述于 WO 04/080180 中。式 I³ 的氨基喹啉酮化合物已描述于 EP A 109 7932 中。作为式 I⁴ 之一或作为氯虫苯甲酰胺的邻氨基苯甲酰胺及其制备已描述于 WO 01/70671 ;WO 02/48137 ;WO03/24222,WO 03/15518,WO 04/67528 ;WO 04/33468 ;和 WO 05/118552 中。丙二腈化合物 CF₃(CH₂)₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H, F₃(CH₂)₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₅CF₂H,

[0382] CF₃(CH₂)₂C(CN)₂(CH₂)₂C(CF₃)₂F,

[0383] F₃(CH₂)₂C(CN)₂(CH₂)₂(CF₂)₃CF₃,

[0384] CF₂H(CF₂)₃CH₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H,

[0385] F₃(CH₂)₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₃,

[0386] CF₃(CF₂)₂CH₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H, 和

[0387] F₃CF₂CH₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H 已描述于 WO 05/63694 中。

[0388] 杀真菌混合伴侣是选自组 F 的那些, 组 F 包括

[0389] F. 1 酰基丙氨酸, 比如苯霜灵, 甲霜灵, 呋酰胺, 噁霜灵;

[0390] F. 2 胺衍生物, 比如 aldimorph, 多果定, 十二环吗啉, 丁苯吗啉, 苯锈啉, 双胍辛, 双胍辛胺, 螺环菌胺, 十三吗啉;

[0391] F. 3 苯胺并嘧啶, 比如嘧霉胺, 嘧菌胺或嘧菌环胺; F. 4 抗生素比如放线菌酮, 灰黄霉素, 春雷霉素, 多马霉素, 多抗霉素或链霉素;

[0392] F. 5 唑类, 比如联苯三唑醇, 糠菌唑, 环丙唑醇, 苯醚甲环唑, 烯唑醇, 氟环唑, 腈苯唑, 氟唑唑, 氟硅唑, 己唑醇, 抑霉唑, 叶菌唑, 腈菌唑, 戊菌唑, 丙环唑, 咪鲜胺, 丙硫菌唑, 戊唑醇, 三唑酮, 三唑醇, 氟菌唑, 灭菌唑, 粉唑醇;

[0393] F. 6 二甲酰亚胺类, 比如异菌脲, 甲菌利, 腐霉利, 乙烯菌核利;

[0394] F. 7 二硫代氨基甲酸酯类, 比如福美铁, 代森钠, 代森锰, 代森锰锌, 百亩酸 (metam), 代森联, 丙森锌, 代森福美锌, 福美双, 福美锌, 代森锌;

[0395] F. 8 杂环化合物, 比如敌菌灵, 苯菌灵, 啉酰菌胺, 多菌灵, 萎锈灵, 氧化萎锈灵, 氰霜唑, 棉隆, 二氰蒽醌, 噁唑菌酮, 咪唑菌酮, 氯苯嘧啶醇, 麦穗宁, 氟酰胺, 呋吡菌胺, 稻瘟灵, 灭锈胺, 氟苯嘧啶醇, 烯丙苯噻唑, 丙氧喹啉, 啉斑肟, 咯唑酮, 苯氧喹啉 (quinoxifen), 硅噻菌胺, 噻菌灵, 噻氟菌胺, 甲基硫菌灵, 噻唑菌酰胺, 三环唑, 噻氮灵;

[0396] F. 9 铜杀真菌剂, 比如波尔多液, 乙酸铜, 王铜, 碱式硫酸铜;

[0397] F. 10 硝基苯基衍生物, 比如乐杀螨, 二硝基巴豆酸酯, 消螨通, 酞菌酯;

[0398] F. 11 苯基吡咯类, 比如拌种咯或咯菌腈;

[0399] F. 12 嗜球果伞素类 (strobilurins) 比如嘧菌酯, 二甲苯氧菌胺, 氟嘧菌酯, 醚菌酯, 苯氧菌胺, 肟醚菌胺, 啉氧菌酯或肟菌酯;

[0400] F. 13 次磺酸衍生物, 比如敌菌丹, 克菌丹, 苯氟磺胺, 灭菌丹, 甲苯氟磺胺;

[0401] F. 14 肉桂酰胺和类似物, 比如烯酰吗啉, 氟酰菌胺或氟吗啉;

[0402] F. 15 硫磺, 以及其它杀真菌剂, 比如活化酯, 苯噻菌胺 (benthiavalicarb), 环丙酰菌胺, 百菌清, 环氟苄酰胺, 霜脲氰, 棉隆, 哒菌酮, 双氯氰菌胺, 乙霉成, 敌瘟磷, 噻唑菌胺, 环酰菌胺, 三苯锡 - 乙酸酯, 稻瘟酰胺, 嘧菌胺, 氟啉胺, 乙膦酸, 三乙膦酸铝, 缙霉威, 六氯苯, metrafenon, 戊菌隆, 霜霉威, 四氯苯酞, 甲基立枯磷, 五氯硝基苯, 苯酰菌胺。

[0403] 因此,提供本文还提供组合物,其包含如第一方面中所定义的式 I 化合物和一种或多种活性成分,比如其它农药(如列表 M 和 / 或 F 中所描述),杀昆虫剂,杀真菌剂,除草剂,肥料比如硝酸铵、脲、钾碱和过磷酸盐,植物毒素和植物生长调节剂,安全剂和杀线虫剂,和任选地一种或多种惯用的配制剂惰性物质;特别优选种子处理组合物。

[0404] 可以通过本领域已知的任意施用方法将动物病虫害,也即昆虫,蛛形动物和线虫,植物,种子,土壤或其中生长植物的水与本发明式 I 化合物或其组合物接触。

[0405] 通过将植物 / 作物用与农药有效量的式 I 化合物接触,所述式 I 化合物或其农药组合物可以用来保护生长中的所述植物和作物免于动物病虫害,特别是昆虫、螨科动物或蛛形动物的侵袭或侵染。根据本发明的活性成分能够用于防治,也即围控或消灭上述类型病虫害,所述病虫害在农业、园艺和林业中尤其发生在植物上,特别是有用植物和观赏植物上,或在所述植物的器官比如果实、花卉、叶、茎秆、块茎、种子或根上,而在某些情况下甚至在之后的时间点形成的植物器官也还保持受保护免于这些病虫害的侵袭。术语“作物”指生长中的和收获的作物。

[0406] 适宜的靶标作物尤其是谷物,比如小麦,大麦,黑麦,燕麦,稻,玉米(饲用玉米和糖用玉米 / 甜质和非甜质玉米)或高粱;甜菜,比如糖用或饲用甜菜;果实,例如仁果,核果或浆果,比如苹果,梨,李,桃,香蕉,扁桃,樱桃或莓果,例如草莓、木莓或黑莓;豆科作物,比如菜豆,小扁豆,豌豆或大豆;油料作物,比如油籽油菜,芥菜,罂粟,橄榄,向日葵,椰子,蓖麻,可可或核桃(ground nuts);葫芦科植物,比如南瓜,黄瓜或甜瓜;纤维植物,比如棉花,亚麻,大麻或黄麻;柑橘类水果,比如橙,柠檬,葡萄柚或红桔;蔬菜,比如菠菜,莴苣,芦笋,卷心菜,冰山植物(iceberg),胡萝卜,洋葱,番茄,马铃薯或灯笼椒;樟科植物,比如鳄梨,樟或樟脑;以及烟草,坚果,咖啡,茄子,甘蔗,茶,胡椒,葡萄藤,啤酒花,车前草科植物,橡胶植物,草地,草坪,牧草,和观赏植物,比如矮牵牛,老鹳草 / 天竺葵,三色堇和凤仙花。

[0407] 此外,所述式 I 化合物还可以用来处理来自植物的种子,所述种子由于育种(包括基因工程方法)耐受除草剂或杀真菌剂或杀昆虫剂的作用。

[0408] 例如,由于常规的育种方法或基因工程已经使得作物耐受除草剂如溴苯腈或者多类除草剂(比如,例如 HPPD 抑制剂,ALS 抑制剂,例如氟嘧磺隆,氟磺隆和三氟啶磺隆(trifloxysulfuron),EPSPS(5-烯醇-丙酮酰-莽草酸-3-磷酸-合成酶)抑制剂,GS(谷氨酰胺合成酶)抑制剂)。已通过常规育种方法(诱变)使其耐受咪唑啉酮类如甲氧咪草烟的作物的实例是**Clearfield®**夏季油菜(Canola)。通过基因工程方法使之耐除草剂或多类除草剂的作物实例包括抗草甘膦和抗草铵膦的玉米品种,该品种可根据商品名**RoundupReady®**和**LibertyLink®**购得。

[0409] 另外,所述式 I 化合物能够还用于处理与存在的植物相比具有经改变特征的植物和种子,所述植物和种子能够例如通过传统育种方法和 / 或产生突变体,或者通过重组方法来产生。例如,已描述了有关为改变植物中合成的淀粉而重组改变栽培作物(例如 WO 92/11376, WO92/14827, WO 91/19806)或者具有经改变的脂肪酸组成的转基因栽培作物(WO 91/13972)的许多情况。

[0410] 此外,可以通过将靶标病虫害、其食物来源、生境、产卵场或其处所与农药有效量的式 I 化合物接触来防治动物病虫害。此处,可以在处所、生长中的作物或收获的作物被病虫害侵染之前或之后进行所述施用。

[0411] 本发明的化合物还能够预防性地施用至预期会出现病虫害的场所。通过将植物与农药有效量的式 I 化合物接触,所述式 I 化合物可以还用来保护生长中的植物免于病虫害侵袭或侵染。此处,“接触”包括直接接触(将所述化合物/组合物直接施用至病虫害和/或植物上——一般是至所述植物的种子、叶、茎干或根上)和间接接触(将所述化合物/组合物施用至病虫害和/或植物的处所)。

[0412] “处所”意指其中正生长或可以生长病虫害或寄生物的生境、产卵场、植物、种子、土壤、区域、材料或环境。

[0413] 通常,“农药有效量”意指对生长实现可观察效果的所需活性分量,所述效果包括坏死,死亡,阻滞,预防,和移除,消灭,或者减少靶标生物的出现和活动。对于本发明中所用的不同化合物/组合物来说农药有效量可以变化。所述组合物的农药有效量也会根据主要的条件比如希望的农药效果和持续期、气候、靶标物种、处所、施用模式等而变化。

[0414] 所述式 I 化合物通过接触(例如,经由土壤、玻璃、墙壁、床帐、地毯、植物部分或动物部分),和摄食(饵剂或植物部分)都是有效的。

[0415] 为了用来对抗蚂蚁、白蚁、蜂、蝇、蚊、蟋蟀或蟑螂,式 I 化合物优选用于饵剂组合物中。

[0416] 所述饵剂能够是液体、固体或半固体制剂(例如凝胶)。固体饵剂能够形成适合各自施用的不同形状和形式,例如颗粒、块料、棒、盘。液体饵剂能够充入不同设备,例如开放的容器、喷雾设备、滴液来源或蒸发源以保证合适的施用。凝胶可以基于含水或含油的基质并且能够将其配制以应对有关粘性、水分保持或老化特征具体需要。

[0417] 组合物所用的饵剂是吸引力足以引诱昆虫比如蚂蚁、白蚁、蜂、蝇、蚊、蟋蟀等或蟑螂将其吞食的产品。所述吸引力可以通过使用摄食刺激剂或性引诱素来操纵。食物刺激剂不受限制地选自,例如动物和/或植物蛋白(肉-、鱼-或血粉,昆虫部分,蛋黄),动物和/或植物来源的脂肪和油,或单-、寡-或多有机糖,特别是蔗糖,乳糖,果糖,右旋糖,葡萄糖,淀粉,果胶或甚至糖蜜或蜜。水果的新鲜或腐败部分,作物,植物,动物,昆虫或其具体部分也可以充当摄食刺激剂。性引诱素已知对昆虫更具特异性。具体的引诱素描述于文献中且为本领域技术人员所已知。

[0418] 作为气雾剂(例如在喷雾罐中),油类喷雾剂或泵喷雾剂的式 I 化合物配制剂对非专业用户防治病虫害比如蝇、蚤、蜱、蚊或蟑螂是高度适宜的。气雾剂配方优选包含所述活性化合物;溶剂比如低级醇(例如甲醇,乙醇,丙醇,丁醇),酮(例如丙酮,甲基乙基酮),具有大约 50 至 250 摄氏度沸腾范围的烷烃(例如煤油),二甲基甲酰胺,N-甲基吡咯烷酮,二甲亚砜,芳族烃比如甲苯、二甲苯,水;还有辅剂比如乳化剂,比如山梨糖醇单油酸酯,具有 3-7mol 环氧乙烷的油烯基乙氧基化物,脂肪醇乙氧基化物,芳香油比如精油,中级脂肪酸与低级醇的酯,芳族羰基化合物;如果合适时,稳定剂比如苯甲酸钠,两性表面活性剂,低级环氧化物,原甲酸三乙基酯以及如果需要时,推进剂比如丙烷、丁烷、氮、经压缩的空气、二甲基醚、二氧化碳、一氧化二氮或这些气体的混合物。

[0419] 所述油类喷雾配制剂与气雾剂配方的区别是不使用推进剂。

[0420] 所述式 I 化合物及其各自的组合物还能够用于蚊香和熏香,烟弹,蒸发器板或长期蒸发器中,以及防蛀纸,防蛀垫或其它热-独立的蒸发器系统中。

[0421] 用式 I 化合物及其各自组合物来防治昆虫传播的感染性疾病(例如疟疾,登革

热和黄热病,淋巴丝虫病,和利什曼病)的方法还包括处理棚舍和房屋表面,空气喷雾和浸渍窗帘、帐篷、衣柜、床帐、刺蝇捕捉器或类似。用于施用至纤维,织物,编织品,无纺布,织网材料或箔和帆布的杀昆虫组合物优选包含包括杀昆虫剂、任选地驱避剂和至少一种粘合剂的混合物。适宜的驱避剂例如是N,N-二乙基-间-甲苯酰胺(DEET),N,N-二乙基苯基乙酰胺(DEPA),1-(3-环己烷-1-基-羰基)-2-甲基胡椒碱(piperine), (2-羟基甲基环己基)乙酸内酯,2-乙基-1,3-己二醇,避蚊酮,甲基新癸酰胺(MNDA),不用于昆虫防治的拟除虫菊酯如{(+/-)-3-烯丙基-2-甲基-4-氧代环戊-2-(+)-烯基-(+)-反-菊酸酯(Esbiothrin),衍生自或相当于植物提取物的驱避剂如柠檬烯,丁香酚,(+)-Eucamalol(1),(-)-i-表-eucamalol或来自植物比如斑皮桉(*Eucalyptus maculata*),单叶蔓荆(*Vitex rotundifolia*),*Cymbopogon martinii*,香茅(*Cymbopogon citratus*)(柠檬茅),亚香茅(*Cymbopogon nardus*)(香茅)的粗植物提取物。适宜的粘合剂例如选自下述物质的聚合物和共聚物:脂族酸乙烯酯(比如乙酸乙烯酯和叔羧酸乙烯酯),醇的丙烯酸和甲基丙烯酸酯,比如丙烯酸丁酯,丙烯酸2-乙基己基酯,和丙烯酸甲酯,一-和二-烯型不饱和的烃,比如苯乙烯,和脂族二烯,比如丁二烯。

[0422] 窗帘和床帐的浸渍通常通过将织物材料浸入杀昆虫剂的乳液或分散液或将其喷雾至所述织物上来完成。

[0423] 所述式I化合物及其组合物能够用于保护木质材料比如树木、木栅栏、枕木等和建筑比如房屋,附属建筑,工厂,以及建筑材料,家具,皮革,纤维,乙烯基类制品,电线和缆线等免受蚂蚁和/或白蚁侵袭,和用于防治蚂蚁和白蚁使其不对作物或人类(例如当所述病虫害侵入房屋和公共设施中时)造成伤害。所述式I化合物不仅施用至周围土壤表面或施用入地板下的土壤以保护木质材料,而且其还能够施用至木材化物品比如地板下的水泥表面,壁橱柱,屋梁,层板,家具等,木质物品比如木屑板,半板(half boards)等和乙烯基类制品比如包裹的电线,乙烯基片材,绝热材料比如苯乙烯泡沫,等等。在施用以抗击对作物或人类造成伤害的蚂蚁的情况下,将本发明的蚂蚁防治剂施用至所述作物或周围土壤,或直接施用至蚂蚁等的巢穴。

[0424] 根据本发明的式I化合物及其组合物的其它应用领域是保护贮藏物品和贮藏室以及保护原材料,比如木质物、织物、地板覆盖物或建筑,还用于卫生领域中,特别是保护人类,家畜和农用牲畜对抗所述类型的病虫害。

[0425] 在卫生领域中,式I化合物及其组合物有活性地对抗外源寄生物比如硬蜱,软蜱,疥螨,收获螨,蝇(叮咬型和舐吸型),寄生性蝇幼虫,虱,毛虱,鸟虱和蚤。

[0426] 所述寄生物的实例是:

[0427] 虱目(Anoplurida):血虱属(*Haematopinus* spp.),长颚虱属(*Linognathus* spp.),人虱属(*Pediculus* spp.)和阴虱属(*Phthirus* spp.),管虱属(*Solenopotes* spp.)。

[0428] 食毛目(Mallophagida):毛羽虱属(*Trimenopon* spp.),*Menopon* spp.,巨羽虱属(*Trinoton* spp.),牛羽虱属(*Bovicola* spp.),*Werneckiella* spp.,*Lepikentron* spp.,*Damalina* spp.,嚼虱属(*Trichodectes* spp.)和猫羽虱属(*Felicola* spp.)。

[0429] 双翅目(Diptera)和长角亚目(Nematocera)和直角短喙象亚目(Brachycera),例如伊蚊属(*Aedes* spp.),按蚊属(*Anopheles* spp.),库蚊属(*Culex* spp.),蚋属(*Simulium* spp.),真蚋属(*Eusimulium* spp.),白蛉属(*Phlebotomus* spp.),

罗蛉属 (*Lutzomyia* spp.), 库蠓属 (*Culicoides* spp.), 斑虻属 (*Chrysops* spp.), 瘤虻属 (*Hybomitra* spp.), 黄虻属 (*Atylotus* spp.), 虻属 (*Tabanus* spp.), 麻虻属 (*Haematopota* spp.), *Philipomyia* spp., 蜂虻属 (*Braula* spp.), 家蝇属 (*Musca* spp.), 齿股蝇属 (*Hydrotaea* spp.), 螫蝇属 (*Stomoxys* spp.), 角蝇属 (*Haematobia* spp.), 莫蝇属 (*Morellia* spp.), 厕蝇属 (*Fannia* spp.), 舌蝇属 (*Glossina* spp.), 丽蝇属 (*Calliphora* spp.), 绿蝇属 (*Lucilia* spp.), 金蝇属 (*Chrysomyia* spp.), 污蝇属 (*Wohlfahrtia* spp.), 麻蝇属 (*Sarcophaga* spp.), 狂蝇属 (*Oestrus* spp.), 皮蝇属 (*Hypoderma* spp.), 胃蝇属 (*Gasterophilus* spp.), 虱蝇属 (*Hippobosca* spp.), 鹿羊虱蝇属 (*Lipoptena* spp.) 和蜚蝇属 (*Melophagus* spp.)。

[0430] 蚤目 (*Siphonapterida*), 例如蚤属 (*Pulex* spp.), 栉首蚤属 (*Ctenocephalides* spp.), 客蚤属 (*Xenopsylla* spp.), 角叶蚤属 (*Ceratophyllus* spp.)。

[0431] 异翅亚目 (*Heteropterida*), 例如臭虫属 (*Cimex* spp.), 椎猎蝽属 (*Triatoma* spp.), 红猎蝽属 (*Rhodnius* spp.), 全圆蝽属 (*Panstrongylus* spp.)。

[0432] 蜚蠊目 (*Blattarida*), 例如东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*), 美洲大蠊 (*Periplaneta americana*), *Blattelagermanica* 和棕带蠊属 (*Supella* spp.)。

[0433] 蜱螨目 (*Acarida*) 和后气门亚目和中气门亚目 (*Meta-and Meso-stigmata*), 例如锐缘蜱属 (*Argas* spp.), 钝缘蜱属 (*Ornithodoros* spp.), 残喙蜱属 (*Otobius* spp.), 硬蜱属 (*Ixodes* spp.), 花蜱属 (*Amblyomma* spp.), 牛蜱属 (*Boophilus* spp.), 革蜱属 (*Dermacentor* spp.), *Haemophysalis* spp., 璃眼蜱属 (*Hyalomma* spp.), 扇头蜱属 (*Rhipicephalus* spp.), 皮刺螨属 (*Dermanyssus* spp.), 刺利螨属 (*Raillietia* spp.), 肺刺螨属 (*Pneumonyssus* spp.), 胸孔螨属 (*Sternostoma* spp.) 和瓦螨属 (*Varroa* spp.)。

[0434] 辐螨亚目 (*Actinedida*) (前气门亚目 (*Prostigmata*)) 和粉螨目 (*Acaridida*) (无气门亚目 (*Astigmata*)), 例如蜂跗线螨属 (*Acarapis* spp.), 姬螯螨属 (*Cheyletiella* spp.), 禽螯厘螨属 (*Ornithocheyletia* spp.), 肉螨属 (*Myobia* spp.), 疮螨属 (*Psorergates* spp.), 蠕形螨属 (*Demodex* spp.), 恙螨属 (*Trombicula* spp.), 牦螨属 (*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.), 瘙螨属 (*Psoroptes* spp.), 痒螨属 (*Chorioptes* spp.), 耳螨属 (*Otodectes* spp.), 疥螨属 (*Sarcoptes* spp.), 痂螨属 (*Notoedres* spp.), 疙螨属 (*Knemidocoptes* spp.), 胞螨属 (*Cytodites* spp.) 和皮膜螨属 (*Laminosioptes* spp.)。

[0435] 式 I 化合物及其组合物还适于在材料比如木质物、织物、塑料、粘合剂、胶水、涂料、纸和卡片、皮革、地板覆盖物和建筑的情况下保护对抗昆虫侵染。

[0436] 在又一方面中, 本发明还涉及防治病虫害的方法, 其包括将如前文所定义的式 I 化合物施用至所述病虫害、要保护的材料和 / 或其环境。在第一实施方式中, 所述材料选自原材料, 比如木材、织物、地板覆盖物和建筑材料。在第二实施方式中, 防治所述病虫害以避免损害贮藏物品。在第三实施方式中, 在卫生领域, 特别是人类、家畜和农用牲畜的保护中防治所述病虫害。

[0437] 在土壤处理或施用至病虫害栖息地或巢穴的情况下, 活性成分的量是 0.0001 至 500g 每 100m², 优选 0.001 至 20g 每 100m²。

[0438] 在材料保护中的常规施用率是,例如 0.01g 至 1000g 式 I 化合物每 m² 经处理的材料,希望的是 0.1g 至 50g 每 m²。

[0439] 在浸渍材料中所用的杀昆虫组合物一般含有 0.001 至 95 重量%,优选 0.1 至 45 重量%,更优选 1 至 25 重量%的至少一种驱避剂和 / 或杀昆虫剂。

[0440] 用于饵剂组合物中时,活性成分的一般含量是 0.001 重量%至 15 重量%,希望的是 0.001 重量%至 5%重量%的式 I 化合物。

[0441] 用于喷雾组合物中时,活性成分的含量是 0.001 至 80 重量%,优选 0.01 至 50 重量%和最优选 0.01 至 15 重量%。

[0442] 用于处理栽培作物中时,本发明活性成分的施用率可以是 0.1g 至 4000g 每公顷,希望的是 25g 至 600g 每公顷,更希望的是 50g 至 500g 每公顷。

[0443] 所述式 I 化合物对于种子保护特别有用,例如,保护种子免于土壤病虫害侵袭,和保护所得植物的根、茎枝和叶对抗土壤病虫害和叶面昆虫。优选的是保护所得植物的根和茎枝。更优选的是保护所得植物的茎枝免于穿刺和吮吸昆虫侵袭,其中保护其免于蚜虫侵袭是最优选的。

[0444] 所以,本发明包括保护种子的方法,例如,免于昆虫侵袭,尤其是免于土壤昆虫侵袭,以及保护幼苗的根、茎枝和叶免于昆虫侵袭,尤其是免于土壤和叶面昆虫侵袭的方法,所述方法包含在播种前和 / 或催芽之后将例如所述种子与所述通式 I 化合物或其盐接触。尤其优选这样的方法,其中保护植物的根、茎枝和 / 或叶;更优选这样的方法,其中保护植物茎枝免于穿刺和吮吸昆虫侵袭;最优选这样的方法,其中保护植物茎枝免于蚜虫侵袭。

[0445] 术语种子涵盖全部种类的种子和植物繁殖体,包括但不限于真种子,种块,根蘖,谷物,鳞茎,果实,块茎,谷粒,根茎,插条,伐条等,而在优选实施方式中意指真种子。

[0446] 本发明还包含用式 I 化合物包衣或含有式 I 化合物的种子。

[0447] 术语“用...包衣和 / 或含有”通常是指所述活性成分在施用时绝大部分在种子的表面上,尽管取决于施用方法所述成分或多或少的部分可以渗入种子材料中。当(重新)栽培所述种子产品时,它可以吸收活性成分。

[0448] 种子处理包含本领域已知的全部适宜种子处理技术,比如拌种,种子包衣,种子喷粉,种子浸泡和种子造粒。化合物式 I 的种子处理施用能够通过任何已知方法比如喷雾进行或者通过在播种种子之前或在播种 / 种植种子期间对种子进行喷粉。

[0449] 对种子处理特别有用的组合物是例如:

[0450] A 可溶液剂 (SL、LS) D 乳液 (EW、EO、ES)

[0451] E 悬浮液 (SC、OD、FS)

[0452] F 水 - 可分散性粒剂和水 - 可溶性颗粒剂 (WG、SG)

[0453] G 水 - 可分散性粉剂和水 - 可溶性粉剂 (WP、SP、WS)

[0454] H 凝胶 - 配制剂 (GF) I 粉剂 (DP、DS)

[0455] 常规的种子处理配制剂包括例如种子处理悬浮剂 FS,种子处理液剂 LS,种子处理干粉剂 DS,种子处理可分散粉剂 WS,种子处理可溶粉剂 SS 和种子处理乳剂 ES 和 EC 以及凝胶剂 GF。这些配制剂能够稀释地或未稀释地施用至种子。向种子的施用在播种之前直接在种子上进行或在已催芽后者之后进行。其还可以在种子播种期间施用。

[0456] 在优选实施方式中,将 FS 配制剂用于种子处理。一般地,FS 配制剂可以包含

1-800g/l 活性成分, 1-200g/l 表面活性剂, 0 至 200g/l 抗冻剂, 0 至 400g/l 粘合剂, 0 至 200g/l 颜料和多至 1 升溶剂, 优选水。

[0457] 用于种子处理特别优选的式 I 化合物 FS 配制剂通常包含 0.1 至 80% 重量 (1 至 800g/l) 活性成分, 0.1 至 20% 重量 (1 至 200g/l) 的至少一种表面活性剂, 例如 0.05 至 5% 重量润湿剂和 0.5 至 15% 重量分散剂, 多至 20% 重量, 例如 5 至 20% 的抗冻剂, 0 至 15% 重量, 例如 1 至 15% 重量的颜料和 / 或染料, 0 至 40% 重量, 例如 1 至 40% 重量的粘合剂 (粘着剂 / 粘附剂), 任选地多至 5% 重量, 例如 0.1 至 5% 重量的增稠剂, 任选地 0.1 至 2% 消泡剂, 和任选地防腐剂比如杀生物剂, 抗氧化剂等, 例如 0.01 至 1% 重量的量, 以及填料 / 赋形剂, 多至 100% 重量。

[0458] 种子处理配制剂另外还可以包含粘合剂和任选地着色剂。

[0459] 可以加入粘合剂以改善处理之后活性材料在种子上的粘附。适宜的粘合剂是嵌段共聚物 EO/PO 表面活性剂, 还是聚乙烯醇, 聚乙烯吡咯烷酮, 聚丙烯酸酯, 聚甲基丙烯酸酯, 聚丁烯, 聚异丁烯, 聚苯乙烯, 聚乙烯胺, 聚乙烯酰胺, 聚乙烯亚胺 (**Lupasol®**, **Polymin®**), 聚醚, 聚氨酯, 聚乙酸乙烯酯, 甲基纤维素 (tylose) 和衍生自这些聚合物的共聚物。

[0460] 任选地, 还可以将着色剂包括入配制剂中。种子处理配制剂的适宜着色剂或染料是罗丹明 B, C. I. 颜料红 112, C. I. 溶剂红 1, 颜料蓝 15:4, 颜料蓝 15:3, 颜料蓝 15:2, 颜料蓝 15:1, 颜料蓝 80, 颜料黄 1, 颜料黄 13, 颜料红 112, 颜料红 48:2, 颜料红 48:1, 颜料红 57:1, 颜料红 53:1, 颜料橙 43, 颜料橙 34, 颜料橙 5, 颜料绿 36, 颜料绿 7, 颜料白 6, 颜料褐 25, 碱性紫 10, 碱性紫 49, 酸性红 51, 酸性红 52, 酸性红 14, 酸性蓝 9, 酸性黄 23, 碱性红 10, 碱性红 108。

[0461] 胶凝剂的实例是角叉菜(**Satiagel®**)

[0462] 在种子处理中, 所述式 I 化合物的施用量通常是 0.1g 至 10kg 每 100kg 种子, 优选 1g 至 5kg 每 100kg 种子, 更优选 1g 至 1000g 每 100kg 种子, 尤其是 1g 至 200g 每 100kg 种子。

[0463] 在又一方面中, 本发明因此还涉及种子, 所述种子包含如前文所定义的式 I 化合物, 或如本文所定义的农业上有用的 I 的盐 (或用其处理)。所述式 I 化合物或其农业上有用的盐的量通常为 0.1g 至 10kg 每 100kg 种子, 优选 1g 至 5kg 每 100kg 种子, 尤其是 1g 至 1000g 每 100kg 种子。对于特定作物比如莴苣用量可以更高。

[0464] 因此, 用式 I 化合物处理的材料指任何材料, 比如例如, 种子, 木质物, 网帐。

[0465] 在本发明的各方面和实施方式中, “基本上由... 组成”及其变化是“包含”及其变化的优选实施方式, 和“由... 组成”及其变化是“基本上由... 组成”及其变化的优选实施方式。

[0466] 以举例说明的方式提供下述实施例, 这并不是为了限制本发明。

实施例

[0467] 实施例 I1: 制备 2-溴-3-硝基-苯酚

[0468]



[0469] 将 2-氨基-3-硝基苯酚 (24.6g, 160mmol) 悬浮于水 (150ml) 与二噁烷 (75ml) 的混合物中。在 80℃ 下滴加氢溴酸 (48%, 85ml)。将此混合物在回流温度下搅拌 30 分钟, 然后冷却至 0℃。滴加亚硝酸钠 (11.04g, 160mmol) 的水 (100ml) 溶液, 在 0℃ 下反应混合物搅拌 1 小时。将反应混合物滴加至 CuBr (26.4g, 184mmol) 的水 (150ml) 和氢溴酸 (48%, 85ml) 溶液中。在 0℃ 下搅拌所得悬浮液 30 分钟, 在 60℃ 下搅拌 1 小时。将反应混合物冷却至室温, 用水稀释, 用乙酸乙酯萃取三次。经合并的有机相在硫酸钠上干燥, 浓缩。残余物通过柱色谱法 (洗脱液: 二氯甲烷 / 环己烷 7 : 3) 在硅胶上纯化, 提供 2-溴-3-硝基-苯酚 (19.5g, 56% 收率), 是黄色固体。¹H-NMR (CDCl₃, 400MHz) : 7.50 (d, 1H), 7.35 (t, 1H), 7.25 (d, 1H), 6.05 (s, 1H) ppm。

[0470] 实施例 12: 制备 2-溴-1-二氟甲氧基-3-硝基-苯

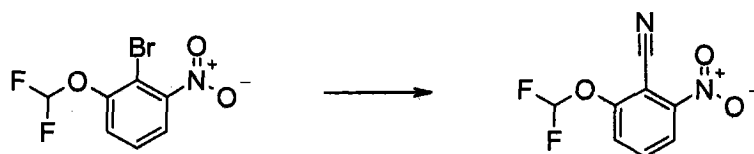
[0471]



[0472] 向氯二氟乙酸钠 (1.29g, 8.5mmol) 与 K₂CO₃ 在 DMF (5ml) 和水 (1.3ml) 中的混合物加入溶于 DMF (5ml) 的 2-溴-3-硝基-苯酚 (0.5g, 2.3mmol), 然后在氩气氛下加热至 100℃, 搅拌 2 小时。将反应混合物冷却至室温, 用水稀释, 用乙酸乙酯萃取三次。经合并的有机相在硫酸钠上干燥, 浓缩, 产生 2-溴-1-二氟甲氧基-3-硝基-苯 (0.56g, 91% 收率), 是纯形式。¹H-NMR (CDCl₃, 400MHz) : 7.65 (m, 1H), 7.45 (m, 2H), 6.60 (t, 1H) ppm。

[0473] 实施例 13: 制备 2-二氟甲氧基-6-硝基-苯基腈

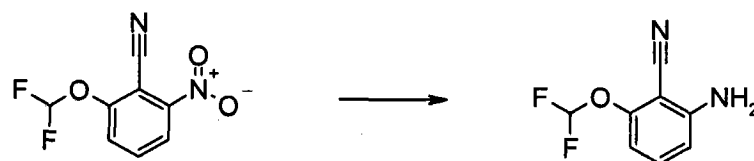
[0474]



[0475] 在 200℃ 下于微波炉中, 将 2-溴-1-二氟甲氧基-3-硝基-苯 (1g, 3.7mmol)、CuCN (0.40g, 4.5mmol) 与 LiBr (0.32g, 3.7mmol) 在四氢呋喃 (10ml) 中的混合物加热 40 分钟。将反应混合物冷却至环境温度, 用甲苯稀释, 用溴化钠水溶液 (1M) 和亚硫酸氢钠水溶液 (饱和) 洗涤。有机相在硫酸钠上干燥, 浓缩。残余物通过 HPLC 纯化, 提供 2-二氟甲氧基-6-硝基苯基腈 (0.67g, 84% 收率)。¹H-NMR (CDCl₃, 400MHz) : 8.20 (d, 1H), 7.85 (t, 1H), 7.75 (d, 1H), 6.75 (t, 1H) ppm。

[0476] 实施例 14: 制备 2-氨基-6-二氟甲氧基-苯基腈

[0477]



[0478] 向 2-二氟甲氧基-6-硝基-苯基腈 (4.0g, 14.9mmol) (实施例 I3) 的异丙醇 (100ml) 溶液加入氯化锡 (II) (10.2g, 53.6mmol)。缓慢加入盐酸 (浓) 水溶液 (14.4ml), 将反应混合物加热至回流 30 分钟。将反应混合物冷却至室温, 用水稀释, 通过加入 NaOH (2M) 将 pH 调节至 10。混合物用乙酸乙酯萃取三次。经合并的有机相在硫酸钠上干燥, 浓缩, 产生 2-氨基-6-二氟甲氧基-苯基腈 (3.32g, 93% 收率), 是纯形式。¹H-NMR (CDCl₃, 400MHz): 7.05 (t, 1H), 6.65 (d, 1H), 6.55 (t, 1H), 6.50 (t, 1H), 4.25 (s, br, 2H) ppm。

[0479] 实施例 15: 制备 2-氰基-3-二氟甲氧基-苯磺酰氯

[0480]



[0481] 将 2-氨基-6-二氟甲氧基-苯基腈 (6.4g, 35mmol) 溶于冰乙酸 (50ml)。在环境温度下滴加盐酸 (37%, 12.7g)。将此混合物冷却至 5°C, 滴加亚硝酸钠 (2.5g, 36.4mmol) 的水 (8ml) 溶液。在 0°C 下搅拌反应混合物 1 小时。在环境温度下, 将所得重氮盐溶液滴加至环境温度下含二氧化硫饱和的冰醋酸 (100ml) 和 CuCl₂ (2.18g, 16.2mmol) 的水 (5ml) 溶液的混合物。所得混合物在环境温度下搅拌 2 小时。将反应混合物倾入冰/水, 用二氯甲烷萃取三次。经合并的有机相在硫酸钠上干燥, 浓缩, 提供 2-氰基-3-二氟甲氧基-苯磺酰氯 (8.5g, 91% 收率), 将其不加进一步纯化地使用。¹H-NMR (CDCl₃, 400MHz): 8.10 (d, 1H), 7.85 (t, 1H), 7.75 (d, 1H), 6.75 (t, 1H) ppm。

[0482] 实施例 16: 用于合成磺酰胺的一般方法

[0483]



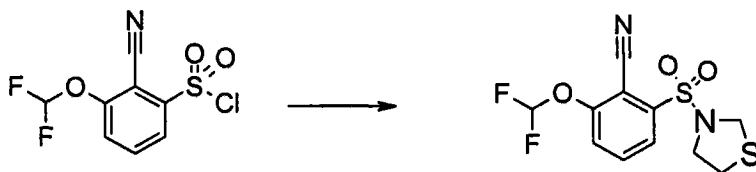
[0484] 通过将氨基衍生物 (0.5mmol) 溶于乙腈 (2ml) 来制备溶液 A。通过将苯磺酰氯 (1mmol) 溶于乙腈 (8ml) 来制备溶液 B。

[0485] 将溶液 A (0.2ml, 50 μmol) 置于孔中, 加入溶液 B (0.2ml, 25 μmol)。在环境温度下搅拌混合物 16 小时。混合物用乙腈 (0.2ml) 稀释, 然后通过 HPLC 纯化, 提供所希望的化合物。

[0486] 该一般方法用来制备下表 P 的化合物。

[0487] 实施例 17: 合成 2-二氟甲氧基-6-(噻唑烷-3-磺酰基)-苯基腈

[0488]



[0489] 在室温下, 将 10ml 的四氢呋喃中的 54mg 2-氰基-3-二氟甲氧基-苯磺酰氯用 32 μl 噻唑烷处理, 搅拌混合物 16 小时。真空浓缩反应混合物。通过 HPLC 纯化, 提供 35mg

2- 二氟甲氧基 -6-(噻唑烷 -3- 磺酰基)- 苯基腈。

[0490] 实施例 I8 : 合成 2- 氟 -6-(噻唑烷 -3- 磺酰基)- 苯基腈

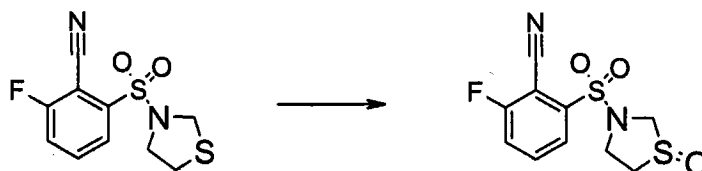
[0491]



[0492] 在室温下, 将 10ml 的四氢呋喃中的 440mg 2- 氰基 -3- 氟 - 苯磺酰氯用 0.36ml 噻唑烷处理, 搅拌混合物 16 小时。真空浓缩反应混合物。通过快速色谱法纯化 (洗脱液: 环己烷 / 乙酸乙酯 1 : 1), 随后用 1M HCl 溶液酸洗, 提供 318mg 2- 氟 -6-(噻唑烷 -3- 磺酰基)- 苯基腈。

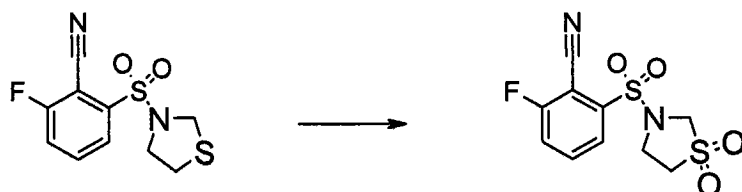
[0493] 实施例 I9 : 合成 2- 氟 -6-(1- 氧代 -1,4- 噻唑烷 -3- 磺酰基)- 苯基腈

[0494]



[0495] 在室温下, 将在 10ml 甲醇 / 1ml 水中的 54mg 2- 氟 -6-(噻唑烷 -3- 磺酰基)- 苯基腈用 45mg 高碘酸钠处理, 搅拌混合物 14 小时。将反应混合物倾至水中, 水层用乙酸乙酯萃取三次。经合并的有机层在硫酸钠上干燥, 过滤, 真空浓缩。通过反相 HPLC 纯化, 提供 40mg 2- 氟 -6-(1- 氧代 -1,4- 噻唑烷 -3- 磺酰基)- 苯基腈。

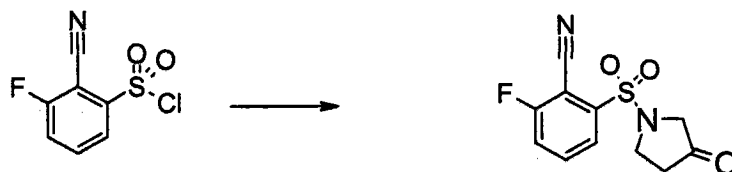
[0496] 实施例 I10 : 合成 2-(1,1- 二氧化 -1,4- 噻唑烷 -3- 磺酰基)-6- 氟 - 苯基腈



[0497] 在室温下, 将 4ml 二氯甲烷中的 54mg 2- 氟 -6-(噻唑烷 -3- 磺酰基)- 苯基腈用 104mg 的 mCPBA (70%) 处理, 搅拌混合物 14 小时。反应混合物用碳酸氢钠饱和溶液洗涤, 水层用二氯甲烷萃取三次。经合并的有机层在硫酸钠上干燥, 过滤, 真空浓缩。通过 HPLC 纯化, 提供 2-(1,1- 二氧化 -1,4- 噻唑烷 -3- 磺酰基)-6- 氟 - 苯基腈。

[0498] 实施例 I11 : 合成 2- 氟 -6-(3- 氧代 - 吡咯烷 -1- 磺酰基)- 苯基腈

[0499]



[0500] 在室温下, 将 5ml 四氢呋喃中的 110mg 2- 氰基 -3- 氟 - 苯磺酰氯用 61mg 的 3- 氧代 - 吡咯烷盐酸盐和 0.14ml 三乙胺处理, 搅拌混合物 16 小时。真空浓缩反应混合物, 将残余物溶于乙酸乙酯, 用 1M HCl 溶液洗涤。通过快速色谱法纯化 (洗脱液: 环己烷 / 乙酸乙

酯 1 : 1), 提供 21mg 2- 氟 -6-(3- 氧代 - 吡咯烷 -1- 磺酰基) - 苯基腈。

[0501] 下述方法用于 LC-MS 分析:

[0502] 方法 A: 具有下述 HPLC 梯度条件 (溶剂 A : 含 0.1% 甲酸的水 / 乙腈 (9 : 1) 和溶剂 B : 含 0.1% 甲酸的乙腈) 的方法 (Waters Alliance 2795LC)

[0503] 时间 (分) A (%) B (%) 流速 (ml/ 分)

[0504] 0 90 10 1.7

[0505] 2.5 0 100 1.7

[0506] 2.8 0 100 1.7

[0507] 2.9 90 10 1.7

[0508] 柱类型 :Waters Atlantis dc18 ; 柱长 :20mm ; 柱内径 :3mm ; 粒径 :3 微米 ; 温度 :40℃。

[0509] 方法 B: 具有下述 HPLC 梯度条件 (溶剂 A : 含 0.1% 甲酸的水 ; 和溶剂 B : 含 0.1% 甲酸的乙腈) 的方法 (Agilent 1100Series)

[0510] 时间 (分) A (%) B (%) 流速 (ml/ 分)

[0511] 0 80 20 1.7

[0512] 2.5 0 100 1.7

[0513] 2.8 0 100 1.7

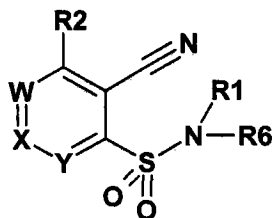
[0514] 2.9 90 10 1.7

[0515] 柱类型 :Waters Atlantis dc18 ; 柱长 :20mm ; 柱内径 :3mm ; 粒径 :3 微米 ; 温度 :40℃。

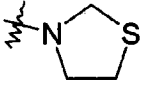
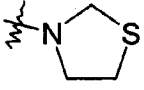
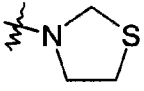
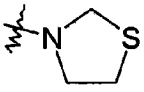
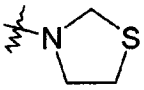
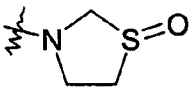
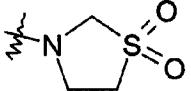
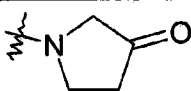
[0516] 用环己烷 / 乙酸乙酯 1 : 1 作洗脱液来测定 R_f 值。

[0517] 表 P : 带表征数据的下式化合物的列表

[0518]



[0519]

	W	X	Y	R2	NR1R6	RT (分)	M+H	LC/MS 方法	Rf
P1.1	CH	CH	CH	OCHF ₂		1.60	320	B	
P1.2	CH	CH	CH	F		1.45	273	B	
P1.3	CH	CH	CH	OMe		1.51	285	B	
P1.4	CH	CH	CH	Me		1.57	269	B	
P1.5	CH	CH	CH	Cl		1.63	289	B	
P1.6	CH	CH	CH	F		1.11	289	B	
P1.7	CH	CH	CH	F		1.28	344.6 M+CH ₃ CN	B	
P1.8	CH	CH	CH	F					0.26

[0520] 在下述测试中,按相对未处理对照的生物学效力来筛选式 I 化合物的经配制溶液。

[0521] 生物学实施例:

[0522] B1:桃蚜 (*Myzus persicae*) (绿色桃蚜) (混合种群,摄食/残留接触活性,预防)

[0523] 将向日葵叶碟置于 24-孔微滴定板中的琼脂上,用 200ppm 的测试溶液喷雾。干燥后,用混龄蚜虫种群侵染所述叶碟。6 天的温育期后,检查样本的死亡率和特殊效果(例如植物毒性)。

[0524] 化合物 P1.1、P1.2 和 P1.5 对桃蚜提供至少 80% 的防治。

[0525] B2:桃蚜 (绿色桃蚜) (混合种群,内吸/摄食活性,治疗)

[0526] 将用混龄蚜虫种群侵染过的豌豆幼苗的根直接置于 24ppm 的测试溶液中。引入 6 天后,检查样本的死亡率和对植株的特殊效果。

[0527] 化合物 P1.1、P1.2、P1.5 和 P1.6 对桃蚜提供至少 80% 防治。

[0528] B3:桃蚜 (绿色桃蚜) (混合种群,药袋试验)

[0529] 将含 12.5ppm 试验化合物的 0.6ml 30% 蔗糖溶液充入 24-孔微滴定板的各孔。为

了制备药袋,各孔用伸展的封口膜覆盖,用桃蚜混龄种群侵染。侵染 6 天之后,检查样品的死亡率(摄食活性)。

[0530] 化合物 P1.1 和 P1.5 对桃蚜提供至少 80%防治。