



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 101421218 B

(45) 授权公告日 2012. 12. 19

(21) 申请号 200780013415. 0

(22) 申请日 2007. 02. 08

(30) 优先权数据

102006007882. 9 2006. 02. 21 DE

(85) PCT申请进入国家阶段日

2008. 10. 14

(86) PCT申请的申请数据

PCT/EP2007/001075 2007. 02. 08

(87) PCT申请的公布数据

W02007/096058 DE 2007. 08. 30

(73) 专利权人 拜耳农作物科学股份公司

地址 德国蒙海姆

(72) 发明人 R·菲舍尔 T·布雷特施奈德

S·莱尔 D·福伊希特

E-M·弗兰肯 O·马萨姆

A·安格曼 G·博杰克 C·阿诺德

M·J·希尔斯 H·科恩

C·H·罗辛格

(74) 专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司

公司 11285

代理人 钟守期 唐铁军

(51) Int. Cl.

C07C 49/225 (2006. 01)

C07C 57/46 (2006. 01)

C07C 233/00 (2006. 01)

C07D 207/36 (2006. 01)

C07D 231/54 (2006. 01)

C07D 307/60 (2006. 01)

A01N 43/08 (2006. 01)

A01N 43/36 (2006. 01)

A01N 43/56 (2006. 01)

(56) 对比文件

US 4558043 A, 1985. 12. 10, 实施例 1.

US 4013690 A, 1977. 03. 22, 实施例 1C.

US 6451843 B1, 2002. 09. 17, 说明书第 2-20 栏, 46-53 栏, 90-94 栏, 表内化合物, 实施例, 权利要求书.

CN 1729157 A, 2006. 02. 01, 实施例 1.

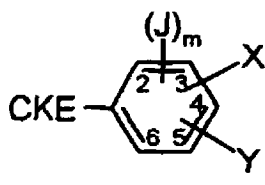
审查员 王加松

权利要求书 16 页 说明书 187 页

(54) 发明名称

环烷基苯基取代的环状酮-烯醇

(57) 摘要

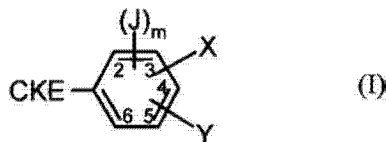


本发明涉及式

(I)

(I) 的新的环烷基苯基取代的环状酮-烯醇类, 其中 J、X、Y、m 和 CKE 具有给定的含义, 涉及制备其的方法和中间体及其作为害虫防治剂和 / 或除草剂的用途。本发明还涉及含有环烷基苯基取代的环状酮-烯醇类和一种改进栽培植物耐受性化合物的选择性除草剂。本发明还涉及通过添加铵盐和 / 或磷盐和任选的促渗剂来提高含有式 (I) 化合物的植物保护剂的活性。

1. 式 (I) 的化合物



其中

J 代表环丙基,

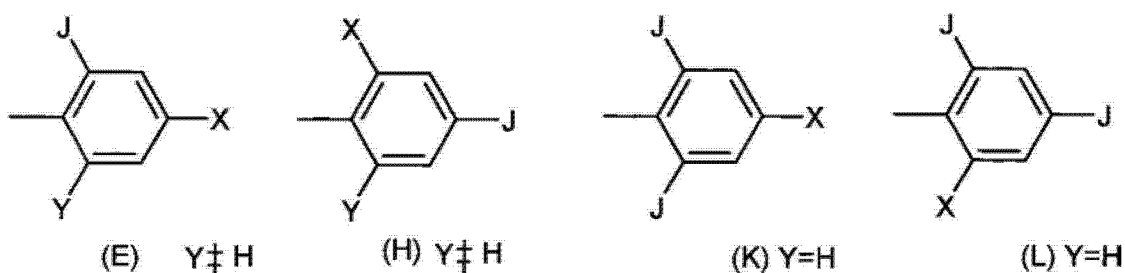
X 代表氯、甲基或乙基,

Y 代表氯、甲基、乙基或氢,

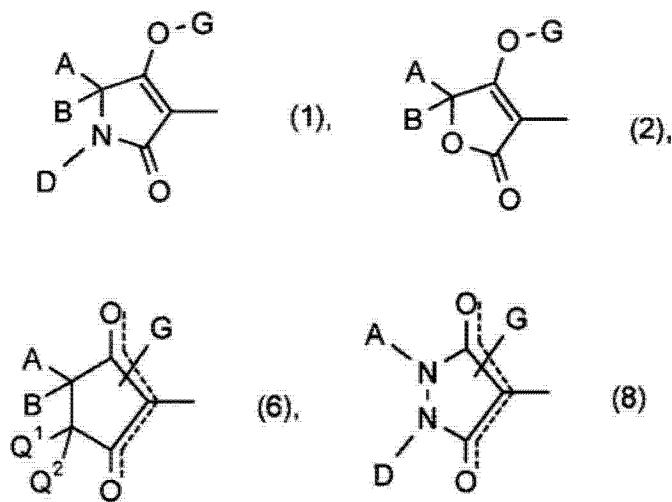
m 代表数值 1 或 2,

条件为基团 J、X 或 Y 中的至少一个位于苯基基团的 2 位上并且不为氢,

其中基团 J、X 和 Y 按以下苯基取代型式排列



CKE 代表以下基团之一



A 代表 C_1-C_4 烷基或环丙基,

B 代表氢或甲基, 或

A、B 与它们所连接的碳原子代表饱和的 C_5-C_6 环烷基, 该环烷基中任选地一个环元素被氧替代并且其任选被甲氧基、乙氧基、丁氧基或甲氧基甲基单取代,

A、B 与它们所连接的碳原子代表 C_6 环烷基, 该环烷基任选被具有两个不直接相邻的氧原子的 C_2-C_3 烷撑二氧基基团取代,

D 代表氢, 或

A 和 D 一起代表 C_3-C_5 烷二基,

A 和 Q^1 一起代表 C_3-C_4 烷二基,

Q^2 代表氢,

G 代表氢 (a) 或代表以下基团之一



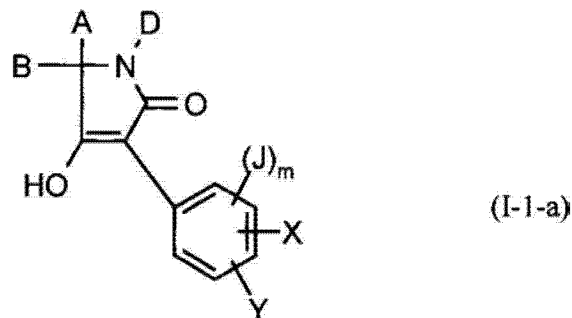
或 $\text{SO}_2\text{-R}^3$ (d)

R^1 代表 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基, 或代表被氯单取代的苯基,

R^2 代表 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷基,

R^3 代表 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷基。

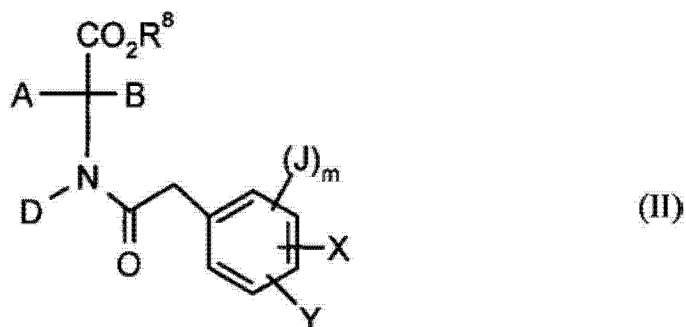
2. 制备权利要求 1 的式 (I) 化合物的方法, 其特征在于, 为获得 (A) 式 (I-1-a) 化合物



其中

A、B、D、J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义,

将式 (II) 化合物在一种稀释剂的存在下并且在一种碱的存在下进行分子内缩合,



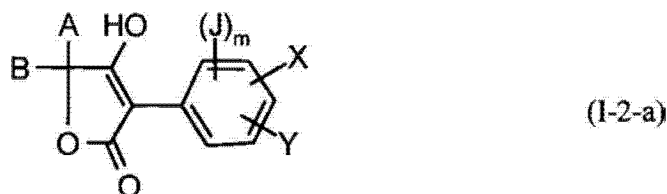
其中

A、B、D、J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义

并且

R^8 代表烷基,

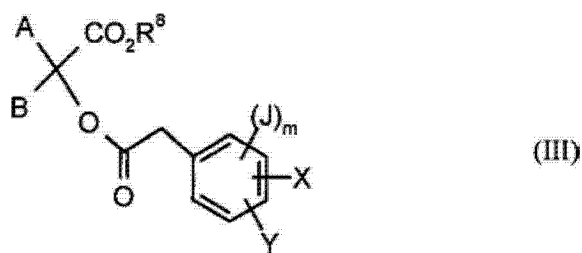
(B) 式 (I-2-a) 化合物



其中

A、B、J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义,

将式 (III) 化合物在一种稀释剂的存在下并且在一种碱的存在下进行分子内缩合,

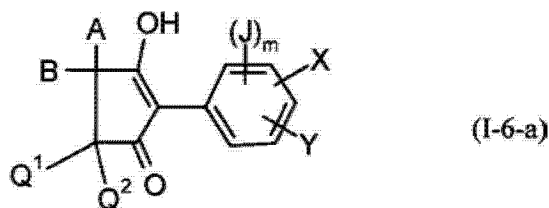


其中

A、B、J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义, 并且

R⁸ 代表烷基,

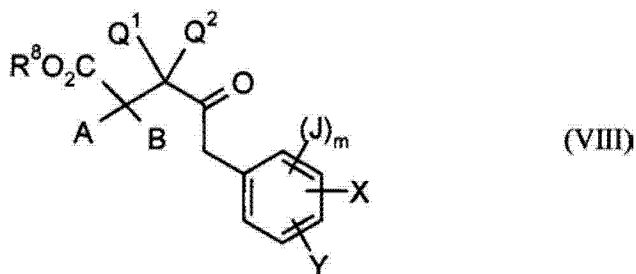
(F) 式 (I-6-a) 化合物



其中

A、B、Q¹、Q²、J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义,

将式 (VIII) 化合物进行分子内环化, 反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且在一种碱的存在下进行,

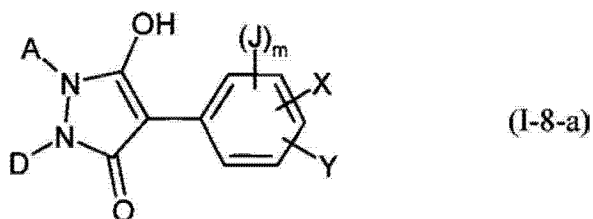


其中

A、B、Q¹、Q²、J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义, 并且

R⁸ 代表烷基,

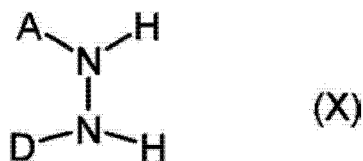
(H) 式 (I-8-a) 化合物



其中

A、D、J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义,

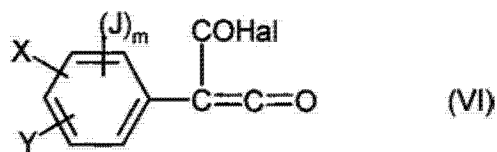
将式 (X) 的化合物



其中

A 和 D 如权利要求 1 定义，

α) 与式 (VI) 的化合物反应，该反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸受体的存在下进行，

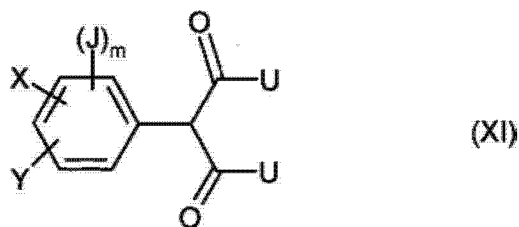


其中

Hal 代表卤素，且 m、X、Y 和 J 如权利要求 1 定义，

或者

β) 与式 (XI) 的化合物反应，该反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种碱的存在下进行，



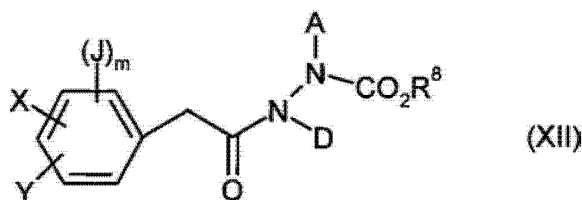
其中

J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义

并且 U 代表 NH₂ 或 O-R⁸，其中 R⁸ 代表烷基，

或者

γ) 与式 (XII) 的化合物反应，该反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种碱的存在下进行，

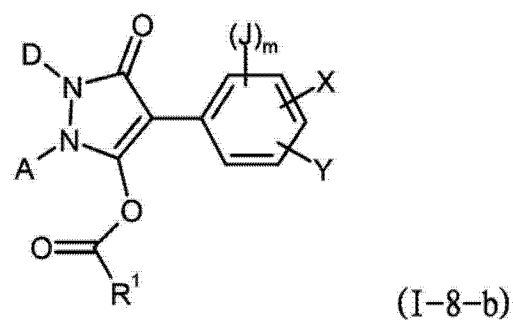
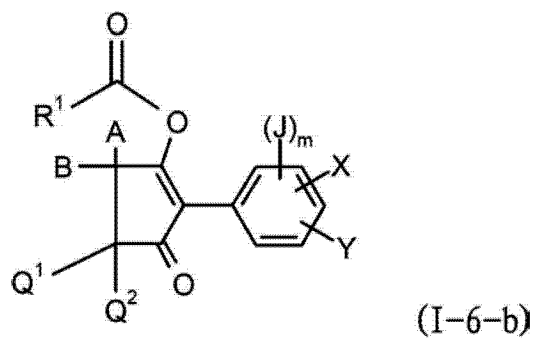
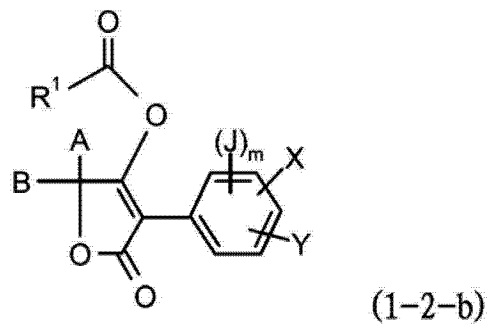
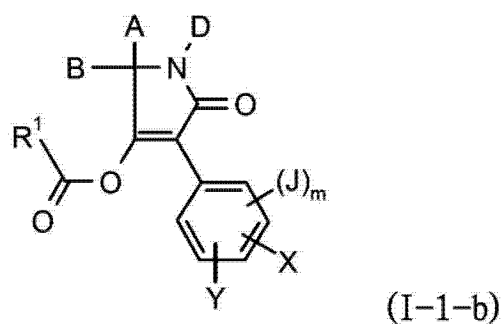


其中

A、D、J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义，并且

R⁸ 代表烷基，

(K) 式 (I-1-b)、(I-2-b)、(I-6-b) 和 (I-8-b) 的化合物



其中

A、B、D、J、m、Q¹、Q²、R¹、X 和 Y 如权利要求 1 定义，

将上面所示式 (I-1-a)、(1-2-a)、(I-6-a) 和 (I-8-a) 的化合物——式中 A、B、D、J、m、Q¹、Q²、X 和 Y 如权利要求 1 定义，各自

(α) 与式 (XV) 的酰卤反应



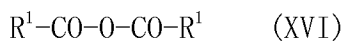
其中

R¹ 如权利要求 1 定义，并且

Hal 代表卤素，

或者

(β) 与式 (XVI) 的羧酸酐反应

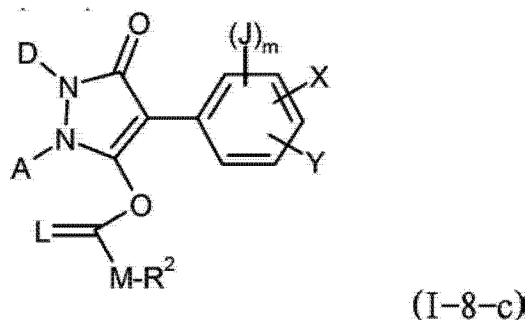
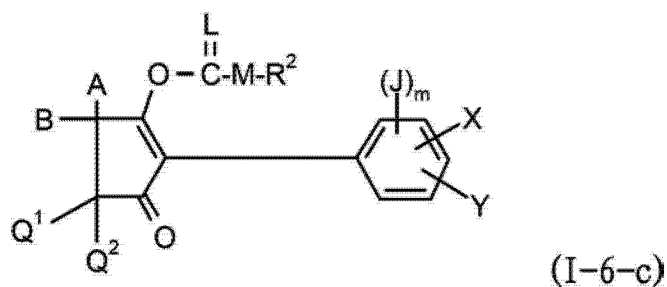
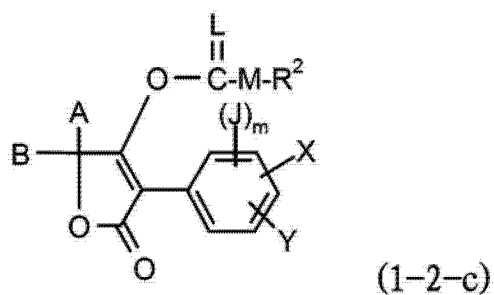
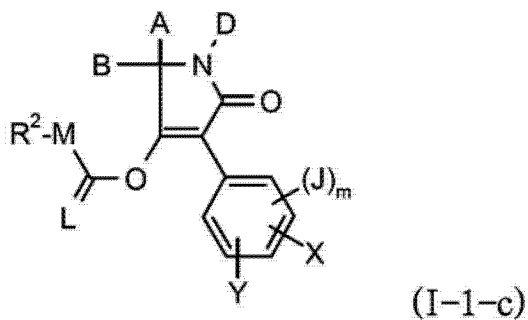


其中

R^1 如权利要求 1 定义，

如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行；

(L) 上面所示式 (I-1-c)、(1-2-c)、(I-6-c) 和 (I-8-c) 的化合物



其中

A、B、D、J、m、 Q^1 、 Q^2 、 R^2 、X 和 Y 如权利要求 1 定义，

L 代表氧，并且

M 代表氧，

将上面所示式 (I-1-a)、(1-2-a)、(I-6-a) 和 (I-8-a) 的化合物——式中 A、B、D、J、m、

Q^1 、 Q^2 、X 和 Y 如权利要求 1 定义,各自与式 (XVII) 的氯甲酸酯反应,该反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行,

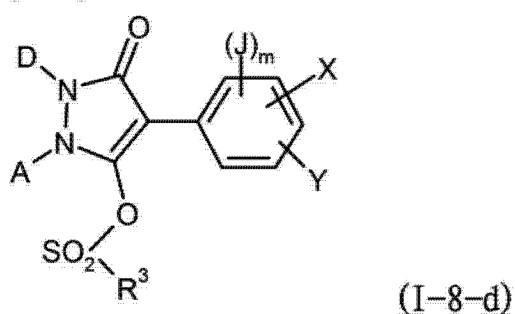
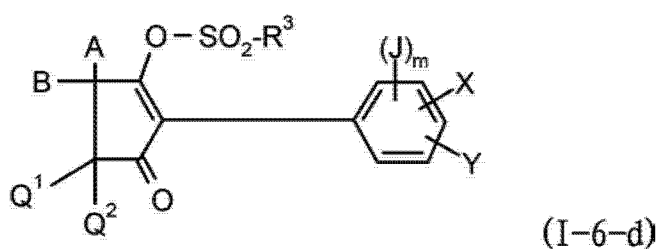
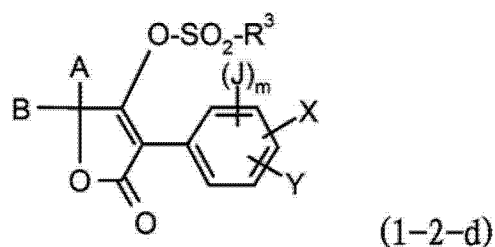
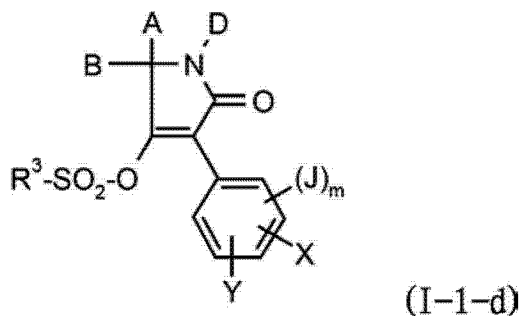


其中

R^2 如权利要求 1 定义,且 M 代表氧;

以及

(N) 上面所示式 (I-1-d)、(I-2-d)、(I-6-d) 和 (I-8-d) 的化合物



其中

A、B、D、J、m、 Q^1 、 Q^2 、 R^3 、X 和 Y 如权利要求 1 定义,

将上面所示式 (I-1-a)、(I-2-a)、(I-6-a) 和 (I-8-a) 的化合物——式中 A、B、D、J、m、 Q^1 、 Q^2 、X 和 Y 如权利要求 1 定义,各自与式 (XIX) 的磺酰氯反应,该反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行,



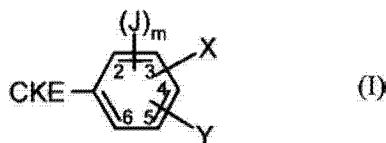
其中

R³ 如权利要求 1 定义。

3. 权利要求 2 的方法, R⁸ 代表 C₁-C₆ 烷基。

4. 含有有效量活性化合物结合物的组合物, 包括以下组分:

(a') 至少一种被取代的式(I) 环状酮-烯醇,



式中 CKE、J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义

和

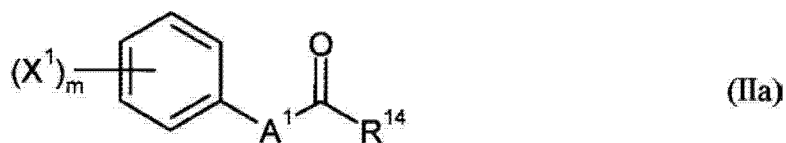
(b') 至少一种改进作物植物相容性的化合物, 该化合物选自以下组的化合物:

4-二氯乙酰基-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷、1-二氯乙酰基六氢-3,3,8a-三甲基吡咯并[1,2-a]-嘧啶-6(2H)-酮、4-二氯乙酰基-3,4-二氢-3-甲基-2H-1,4-苯并噁嗪、5-氯喹啉-8-氧乙酸-1-甲基己基酯、3-(2-氯苄基)-1-(1-甲基-1-苯基乙基)脲、 α -(氰基甲氧亚氨基)苯基乙腈、2,4-二氯苯氧基乙酸、4-(2,4-二氯苯氧基)丁酸、1-(1-甲基-1-苯基乙基)-3-(4-甲基苯基)脲、3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸、S-1-甲基-1-苯基乙基哌啶-1-硫代羧酸酯、2,2-二氯-N-(2-氧代-2-(2-丙烯基氨基)乙基)-N-(2-丙烯基)乙酰胺、2,2-二氯-N,N'-二-2-丙烯基乙酰胺、4,6-二氯-2-苯基嘧啶、1-(2,4-二氯苄基)-5-三氯甲基-1H-1,2,4-三唑-3-羧酸乙酯、2-氯-4-三氟甲基噻唑-5-羧酸苯甲酯、4-氯-N-(1,3-二氧戊环-2-基甲氧基)- α -三氟苯乙酮肟、3-二氯乙酰基-5-(2-呋喃基)-2,2-二甲基噁唑烷、4,5-二氢-5,5-二苯基-3-异噁唑羧酸乙酯、1-(乙氧基羰基)乙基-3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸酯、(4-氯-o-甲苯氧基)乙酸、2-(4-氯-o-甲苯氧基)丙酸、1-(2,4-二氯苄基)-4,5-二氢-5-甲基-1H-吡唑-3,5-二羧酸二乙酯、2-二氯甲基-2-甲基-1,3-二氧戊环、2-丙烯基-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷-4-二硫代羧酸酯、1,8-萘二甲酸酐、 α -(1,3-二氧戊环-2-基甲氧亚氨基)-苯基乙腈、2,2-二氯-N-(1,3-二氧戊环-2-基甲基)-N-(2-丙烯基)乙酰胺、3-二氯乙酰基-2,2-二甲基噁唑烷、3-二氯乙酰基-2,2,5-三甲基噁唑烷、4-(4-氯-o-甲苯基)丁酸、4-(4-氯苯氧基)丁酸、二苯基甲氧基乙酸、二苯基甲氧基乙酸甲酯、二苯基甲氧基乙酸乙酯、1-(2-氯苄基)-5-苯基-1H-吡唑-3-羧酸甲酯、1-(2,4-二氯苄基)-5-甲基-1H-吡唑-3-羧酸乙酯、1-(2,4-二氯苄基)-5-异丙基-1H-吡唑-3-羧酸乙酯、1-(2,4-二氯苄基)-5-(1,1-二甲基乙基)-1H-吡唑-3-羧酸乙酯、1-(2,4-二氯苄基)-5-苯基-1H-吡唑-3-羧酸乙酯、5-(2,4-二氯苄基)-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯、5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯、5-(4-氟苄基)-5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯、1,3-二甲基丁-1-基-5-氯喹啉-8-氧基乙酸酯、4-烯丙氧基丁基-5-氯喹啉-8-氧基乙酸酯、1-烯丙氧基丙-2-基-5-氯喹啉-8-氧基乙酸酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸甲酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸乙酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸烯丙酯、2-氧代丙-1-基-5-氯喹啉-8-氧基乙酸酯、5-氯喹啉-8-氧基丙二酸二乙酯、5-氯喹啉-8-氧基丙二酸二烯丙酯、5-氯喹啉-8-氧基丙二酸二乙酯、4-羧基苯并二氢吡喃-4-基乙酸、4-氯苯氧基乙酸、3,3'-二甲基-4-甲氧基二苯甲酮、1-溴-4-氯甲基磺酰基苯、1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨磺酰基)苯基]-3-甲基脲、1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨磺酰基)苯基]-3,3-二甲基脲、1-[4-(N-4,5-二甲基苯甲酰基氨磺酰基)苯基]

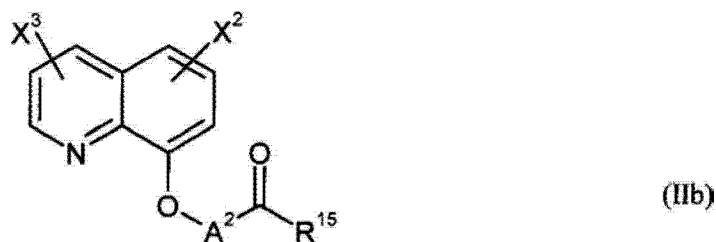
基]-3-甲基脲、1-[4-(N-萘基氨磺酰基)苯基]-3,3-二甲基脲、N-(2-甲氧基-5-甲基苯甲酰基)-4-(环丙基氨基羰基)苯磺酰胺,

和/或由以下通式定义的化合物中的一种:

通式(II a)



或通式(II b)



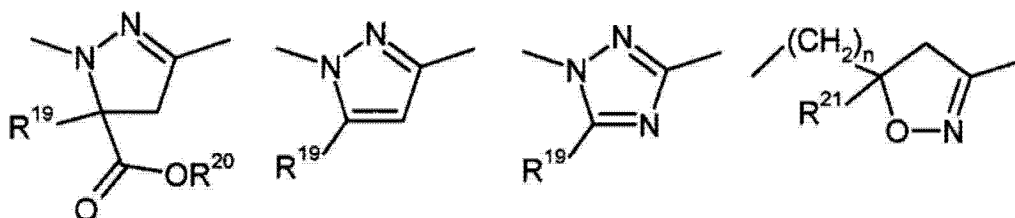
或通式(II c)



其中

m 代表数值 0、1、2、3、4 或 5,

A¹ 代表以下所示二价杂环基团之一



n 代表数值 0、1、2、3、4 或 5,

A² 代表任选被 C₁-C₄ 烷基和/或 C₁-C₄ 烷氧基羰基和/或 C₁-C₄ 烯氧基羰基取代的具有 1 或 2 个碳原子的烷二基,

R¹⁴ 代表羟基、巯基、氨基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 烷基氨基或二(C₁-C₄ 烷基)氨基,

R¹⁵ 代表羟基、巯基、氨基、C₁-C₇ 烷氧基、C₁-C₆ 烯氧基、C₁-C₆ 烯氧基-C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 烷基氨基或二(C₁-C₄ 烷基)氨基,

R¹⁶ 代表各自任选被氟、氯和/或溴取代的 C₁-C₄ 烷基,

R¹⁷ 代表氢,各自任选被氟、氯和/或溴取代的 C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烯基或 C₂-C₆ 炔基、C₁-C₄ 烷氧基-C₁-C₄ 烷基、二氧戊环基-C₁-C₄ 烷基、呋喃基、呋喃基-C₁-C₄ 烷基、噻吩基、噻唑基、哌啶基,或任选被氟、氯和/或溴或者 C₁-C₄ 烷基取代的苯基,

R¹⁸ 代表氢,各自任选被氟、氯和/或溴取代的 C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烯基或 C₂-C₆ 炔基、C₁-C₄ 烷氧基-C₁-C₄ 烷基、二氧戊环基-C₁-C₄ 烷基、呋喃基、呋喃基-C₁-C₄ 烷基、噻吩基、噻唑基、哌

啶基,或任选被氟、氯和 / 或溴或者 C_1-C_4 烷基取代的苯基,

R^{17} 和 R^{18} 还一起代表各自任选被 C_1-C_4 烷基、苯基、呋喃基、稠合苯环取代或被两个与它所连接的 C 原子一起形成一个 5 元或 6 元碳环的取代基取代的 C_3-C_6 烷二基或 C_2-C_5 氧杂烷二基,

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

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

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

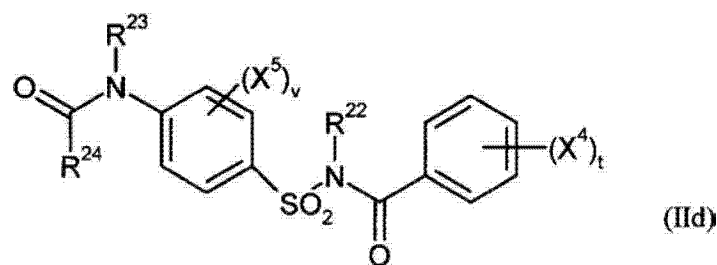
X^1 代表硝基、氰基、卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 卤代烷氧基,

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

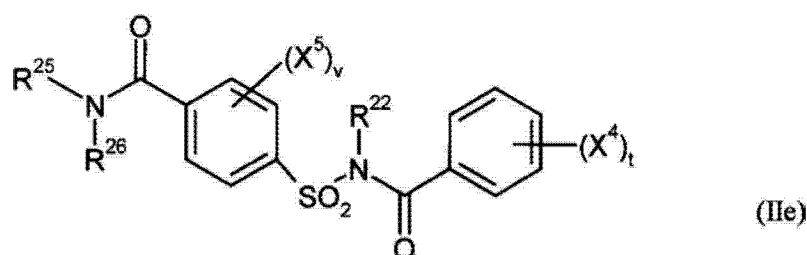
X^3 代表氢、氰基、硝基、卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 卤代烷氧基,

和 / 或由以下通式定义的化合物:

通式 (II d)



或通式 (II e)



其中

t 代表数值 0、1、2、3、4 或 5,

v 代表数值 0、1、2、3、4 或 5,

R^{22} 代表氢或 C_1-C_4 烷基,

R^{23} 代表氢或 C_1-C_4 烷基,

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

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

基,

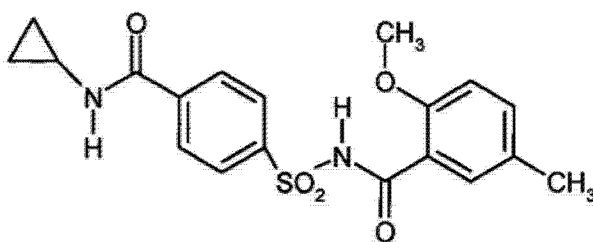
或者被 C_1-C_4 烷基取代的 C_3-C_6 环烷基, 或者任选被硝基、氰基、卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 卤代烷氧基取代的苯基, 或者与 R^{25} 一起代表各自任选被 C_1-C_4 烷基取代的 C_2-C_6 烷二基或 C_2-C_5 氧杂烷二基,

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

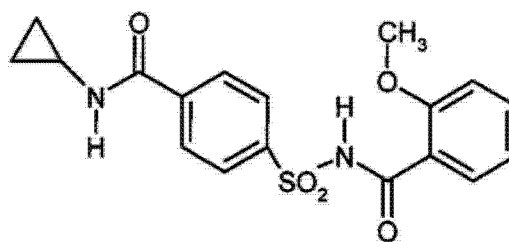
X^5 代表硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、甲酰基、氨基磺酰基、羟基、氨基、卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 卤代烷氧基。

5. 根据权利要求 4 的组合物, 其中改进作物植物相容性的化合物选自以下组的化合物:

解草酯、解草唑、双苯噁唑酸、吡唑解草酯、解草恶唑、解草啉、苄草隆、杀草隆或者以下化合物



和



6. 根据权利要求 4 和 5 之一的组合物, 其中改进作物植物相容性的化合物为解草酯。

7. 根据权利要求 4 和 5 之一的组合物, 其中改进作物植物相容性的化合物为吡唑解草酯。

8. 用于防治害虫和 / 或不想要的植物的组合物, 其特征在于它们含有至少一种权利要求 1 中式 (I) 的化合物。

9. 用于防治动物有害物和 / 或不想要的植物的方法, 其特征在于将权利要求 1 中式 (I) 的化合物作用于害虫、不想要的植物和 / 或其生境。

10. 权利要求 1 中式 (I) 的化合物用于防治动物有害物和 / 或不想要的植物的用途。

11. 制备用于防治害虫和 / 或不想要的植物的组合物的方法, 其特征在于将权利要求 1 中式 (I) 的化合物与填充剂和 / 或表面活性剂混合。

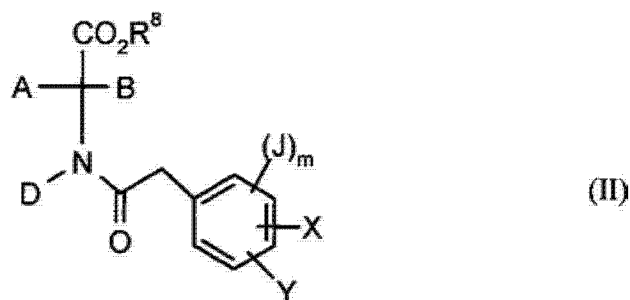
12. 权利要求 1 中式 (I) 的化合物用于制备用于防治害虫和 / 或不想要的植物的组合物的用途。

13. 用于防治不想要的植物的方法, 其特征在于将权利要求 4 的组合物作用于植物或其生境。

14. 权利要求 4 的组合物用于防治不想要的植物的用途。

15. 用于防治不想要的植物的方法,其特征在于将权利要求 1 中式 (I) 的化合物和权利要求 4 中改进作物植物相容性的化合物以接近的时间顺序分别作用于植物或其生境。

16. 式 (II) 的化合物



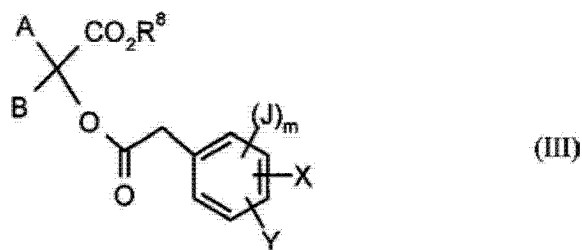
其中

A、B、D、J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义

并且

R⁸ 代表烷基。

17. 式 (III) 的化合物

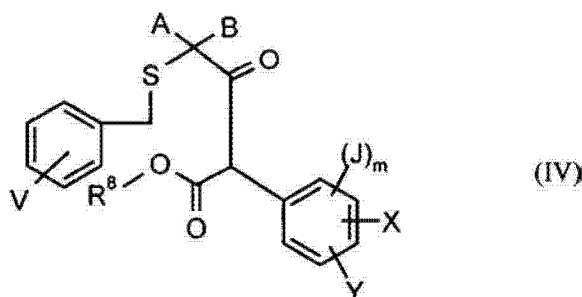


其中

A、B、J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义,并且

R⁸ 代表烷基。

18. 式 (IV) 的化合物



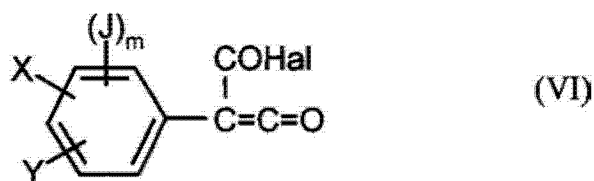
其中

A、B、J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义,

R⁸ 代表烷基,

并且 V 代表氢、卤素、烷基或烷氧基。

19. 式 (VI) 的化合物

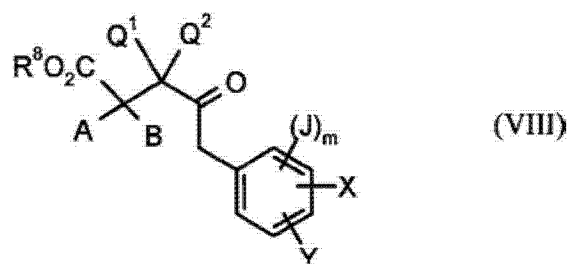


其中

J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义，

并且 Hal 代表卤素。

20. 式 (VIII) 的化合物

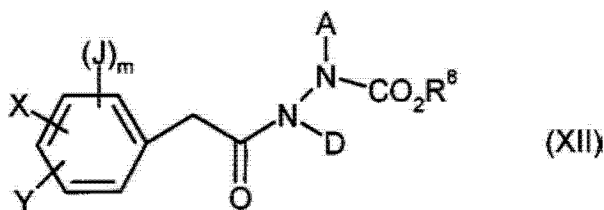


其中

A、B、Q¹、Q²、J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义，并且

R⁸ 代表烷基。

21. 式 (XII) 的化合物

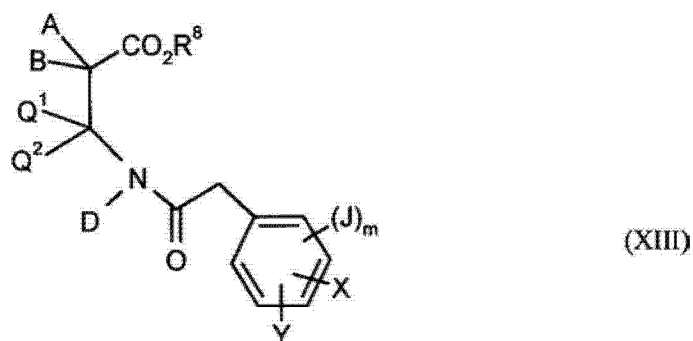


其中

A、D、J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义，并且

R⁸ 代表烷基。

22. 式 (XIII) 的化合物

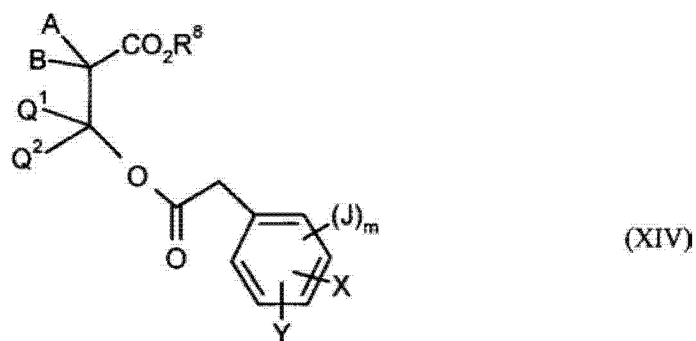


其中

A、B、D、J、m、Q¹、Q²、X 和 Y 如权利要求 1 定义，并且

R⁸ 代表烷基。

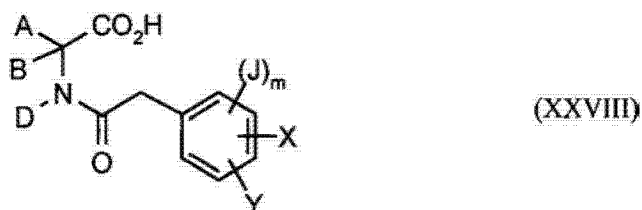
23. 式 (XIV) 的化合物



其中

A、B、J、m、Q¹、Q²、X 和 Y 如权利要求 1 定义, 并且
R⁸ 代表烷基。

24. 式 (XXVIII) 的化合物



其中

A、B、D、J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义。

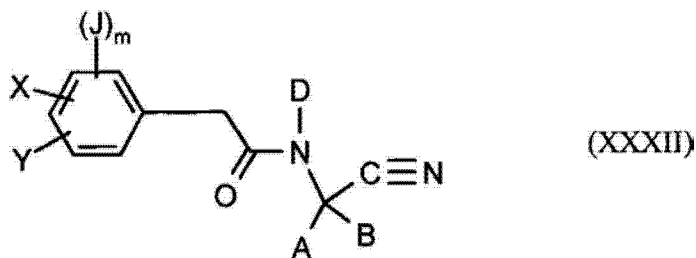
25. 式 (XXVII) 的化合物



其中

J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义, 并且
Z 代表由羧酸活化试剂引入的离去基团。

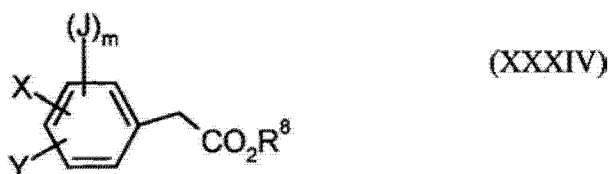
26. 式 (XXXII) 的化合物



其中

A、B、D、J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义。

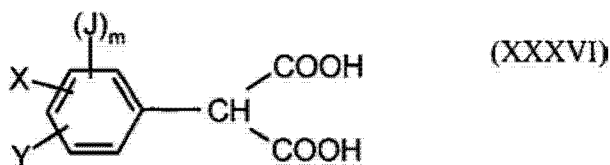
27. 式 (XXXIV) 的化合物



其中

J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义, 并且
R⁸ 代表烷基。

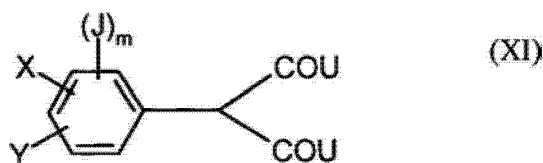
28. 式 (XXXVI) 的化合物



其中

J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义。

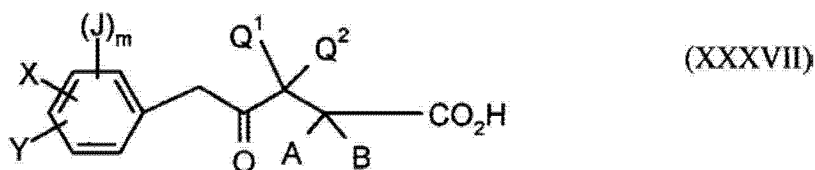
29. 式 (XI) 的化合物



其中

J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义, U 代表 OR⁸, 并且 R⁸ 代表烷基。

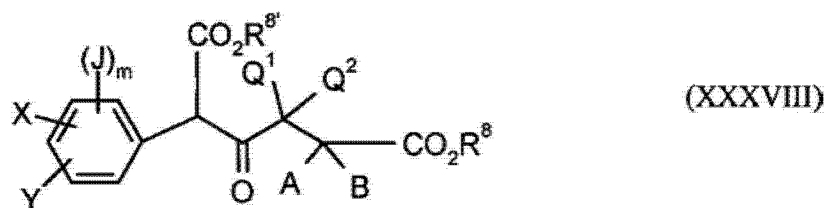
30. 式 (XXXVII) 的化合物



其中

J、m、X、Y、A、B、Q¹ 和 Q² 如权利要求 1 定义。

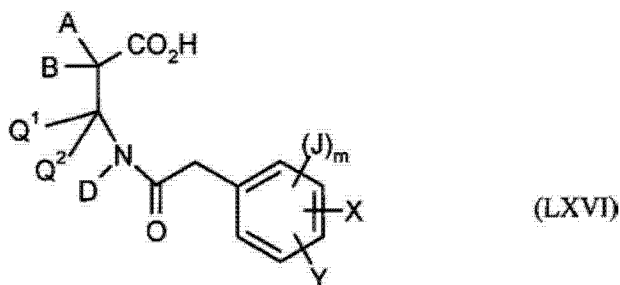
31. 式 (XXXVIII) 的化合物



其中

A、B、J、m、Q¹、Q²、X 和 Y 如要求 1 定义,
R⁸ 和 R^{8'} 代表烷基。

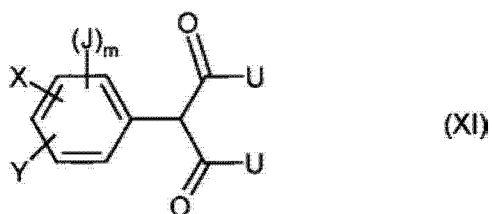
32. 式 (LXVI) 的化合物



其中

A、B、J、m、D、Q¹、Q²、X 和 Y 如权利要求 1 定义。

33. 式 (XI) 的化合物

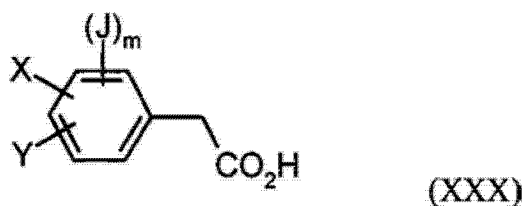


其中

J、m、X 和 Y 如权利要求 1 定义, 并且

U 代表 NH₂ 或 O-R⁸, 其中 R⁸ 代表烷基。

34. 式 (XXX) 的化合物



其中

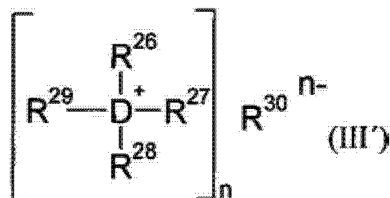
J、X、Y 和 m 如权利要求 1 定义。

35. 组合物, 含有

- 至少一种权利要求 1 中式 (I) 的化合物或权利要求 4 中的一种组合物,

和

- 至少一种式 (III') 的盐



其中

D 代表氮或磷,

R²⁶、R²⁷、R²⁸ 和 R²⁹ 相互独立地代表氢, 或各自任选被取代的 C₁-C₈ 烷基或者单不饱和或多不饱和的任选被取代的 C₁-C₈ 烯基, 其中所述取代基可选自卤素、硝基和氰基,

n 代表 1、2、3 或 4,

R³⁰ 代表一种无机或有机阴离子。

36. 权利要求 35 的组合物, 其特征在于它含有至少一种渗透剂。

37. 用于改进含有权利要求 1 中式 (I) 的一种活性化合物或权利要求 4 中组合物的杀虫剂和 / 或除草剂的活性的方法, 其特征在于即用型组合物使用权利要求 35 中式 (III') 的一种盐制备。

38. 用于改进含有权利要求 1 中式 (I) 的一种活性化合物或权利要求 4 中组合物的杀虫剂和 / 或除草剂的活性的方法, 其特征在于喷雾液剂使用权利要求 35 中式 (III') 的一种盐制备。

39. 权利要求 38 的方法, 其特征在于喷雾液剂使用一种渗透剂制备。

环烷基苯基取代的环状酮 - 烯醇

[0001] 本发明涉及新的环烷基苯基取代的环状酮 - 烯醇,其多种制备方法和将其用作杀虫剂和 / 或除草剂的用途。本发明还提供首先含有所述环烷基苯基取代的环状酮 - 烯醇,其次含有一种改进作物植物相容性的化合物的选择性除草组合物。

[0002] 本发明还涉及通过向相应的组合物中添加铵盐或磷盐,并且如果合适,添加渗透剂来增加特别是含有环烷基苯基取代的环状酮 - 烯醇的作物保护组合物的活性,涉及该组合物的制备方法及其在作物保护中用作杀虫剂和 / 或杀螨剂和 / 或用于防治不想要的植物的用途。

[0003] 3- 酰基吡咯烷 -2,4- 二酮的药学特性在现有技术中有记载 (S. Suzuki et al. 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,但这些化合物的生物活性尚无记载。

[0004] EP-A-0 262 399 和 GB-A-2 266 888 公开了类似结构的化合物 (3- 芳基吡咯烷 -2,4- 二酮);但是,这些化合物的除草、杀虫或杀螨活性是未知的。已知具有除草、杀虫或杀螨活性的是未被取代的双环的 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),以及被取代的单环的 3- 芳基吡咯烷 -2,4- 二酮衍生物 (EP-A-377 893 和 EP-A-442 077)。

[0005] 还已知的为多环的 3- 芳基吡咯烷 -2,4- 二酮衍生物 (EP-A-442 073),以及 1H- 芳基吡咯烷二酮衍生物 (EP-A-456063、EP-A-521334、EP-A-596298、EP-A-613884、EP-A-613885、W095/01997、W095/26954、W095/20572、EP-A-0668267、W096/25395、W096/35664、W097/01535、W097/02243、W097/36868、W097/43275、W098/05638、W098/06721、W098/25928、W099/16748、W099/24437、W099/43649、W099/48869 和 W099/55673、W001/17972、W001/23354、W001/74770、W003/013249、W004/007448、W004/024688、W004/065366、W004/080962、W004/111042、W005/044791、W005/044796、W005/048710、W005/049596、W005/066125、W005/092897、W006/000355、W006/029799、W006/056281、W006/056282、W006/089633、DE-A-05051325、DE-A-05059891)。

[0006] 已知某些被取代的 Δ^3 - 二氢呋喃 -2- 酮衍生物具有除草特性 (参见 DE-A-4014420)。用作起始物质的特窗酸衍生物 (例如 3- (2- 甲基苯基) -4- 羟基 -5- (4- 氟苯基) - Δ^3 - 二氢呋喃酮 - (2)) 的合成也在 DE-A-4 014 420 中有描述。不具有所述杀虫和 / 或杀螨活性的类似结构的化合物已知于出版物 Campbell et al., J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1, 1985, (8) 1567-76。此外,具有除草、杀螨和杀虫特性的 3- 芳基 - Δ^3 - 二氢呋喃酮衍生物已知于 EP-A-528156、EP-A-0647637、W095/26345、W096/20196、W096/25395、W096/35664、W097/01535、W097/02243、W097/36868、W098/05638、W098/25928、W099/16748、W099/43649、W099/48869、W099/55673、W001/17972、W001/23354 和 W001/74770、W003/013249、W004/024688、W004/080962、W004/111042、W005/092897、W006/000355、W006/029799、W006/089633、DE-A-05051325、DE-A-05059891。还已知的有 3- 芳基 - Δ^3 - 二氢噻吩酮衍生物 (W095/26345、96/25395、W097/01535、W097/02243、W097/36868、W098/05638、W098/25928、W099/16748、W099/43649、W099/48869、W099/55673、W001/17972、

W001/23354、W001/74770、W003/013249、W004/080962、W004/111042、W005/092897、W006/029799)。

[0007] 某些苯环上未被取代的苯基吡喃酮衍生物已经已知(参见 A. M. Chirazi, T. Kappe and E. Ziegler, Arch. Pharm. 309, 558 (1976) 和 K. -H. Bol tze and K. Heidenbluth, Chem. Ber. 91, 2849); 但是, 未对这些化合物可能用作杀虫剂的用途进行陈述。苯环上被取代并且具有除草、杀螨和杀昆虫特性的苯基吡喃酮衍生物在 EP-A-588137、W096/25395、W096/35664、W097/01535、W097/02243、W097/16436、W097/19941、W097/36868、W098/05638、W099/43649、W099/48869、W099/55673、W001/17972、W001/74770、W003/013249、W004/080962、W004/111042、W005/092897、W006/029799 中有记载。

[0008] 某些苯环上未被取代的 5- 苯基 -1,3- 噻嗪衍生物已经已知(参见 E. Ziegler and E. Steiner, Monatsh. 95, 147 (1964), R. Ketcham, T. Kappe and E. Ziegler, J. Heterocycl. Chem. 10, 223 (1973)); 但是, 未对这些 化合物可能用作杀虫剂的用途进行陈述。苯环上被取代并且具有除草、杀螨和杀昆虫活性的 5- 苯基 -1,3- 噻嗪衍生物在 W094/14785、W096/02539、W096/35664、W097/01535、W097/02243、W097/02243、W097/36868、W099/05638、W099/43649、W099/48869、W099/55673、W001/17972、W001/74770、W003/013249、W004/080962、W004/111042、W005/092897、W006/029799 中有记载。

[0009] 已知某些被取代的 2- 芳基环戊二酮具有除草、杀昆虫和杀螨特性(参见, 例如 US-4283348; 4338122; 4436666; 4526723; 4551547; 4632698; W096/01798; W096/03366, W097/14667 以及 W098/39281、W099/43649、W099/48869、W099/55673、W001/17972、W001/74770、W003/013249、W004/080962、W004/111042、W005/092897、W006/029799)。还已知的为以类似方式被取代的化合物; 3- 羟基 -5,5- 二甲基 -2- 苯基环戊 -2- 烯 -1- 酮, 已知于出版物 Micklefield et al., Tetrahedron, (1992), 7519-26, 和天然化合物 involutin(-)- 顺 -5-(3,4- 二羟基苯基) -3,4- 二羟基 -2-(4- 羟基苯基) 环戊 -2- 烯酮, 已知于出版物 Edwards et al., J. Chem. Soc. S, (1967), 405-9。未描述杀昆虫或杀螨活性。还已知的为 2-(2,4,6- 三甲基苯基) -1,3- 茛满二酮, 已知于出版物 J. Economic Entomology, 66, (1973), 584 和公开的出版物 DE-A2361084, 并对其除草和杀螨活性进行了描述。

[0010] 已知某些被取代的 2- 芳基环己二酮具有除草、杀昆虫和杀螨特性 (US-4175135、4209432、4256657、4256658、4256659、4257858、4283348、4303669、4351666、4409153、4436666、4526723、4613617、4659372、DE-A2813341, 以及 Wheeler, T. N., J. Org. Chem. 44, 4906 (1979)), W099/43649、W099/48869、W099/55673、W001/17972、W001/74770、W003/013249、W004/080962、W004/111042、W005/092897、W006/029799)。

[0011] 已知某些被取代的 4- 芳基吡唑烷 -3,5- 二酮具有杀螨、杀昆虫和除草特性(参见, 例如 W092/16510、EP-A-508126、W096/11574、W096/21652、W099/47525、W001/17351、W001/17352、W001/17353、W001/17972、W001/17973、W003/028466、W003/062244、W004/080962、W004/111042、W005/005428、W005/016873、W005/092897、W006/029799)。

[0012] 已知某些四氢吡啶酮具有除草特性: JP-A-0832530。还已知的为特定的具有杀螨、杀昆虫及除草特性的 4- 羟基四氢吡啶酮类: JP-A-11152273。此外, 在 W001/79204 中公开了 4- 羟基四氢吡啶酮类用作杀虫剂和除草剂。

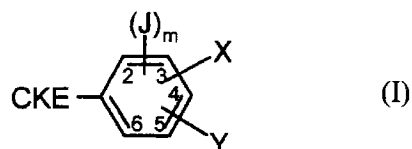
[0013] 还已知某些 5,6- 二氢吡喃酮衍生物作为蛋白酶抑制剂具有抗病毒特

性:W095/14012。此外,4-苯基-6-(2-苯乙基)-5,6-二氢吡喃酮已知于卡瓦内酯(kavalactone)衍生物的合成:Kappe et al., Arch. Pharm. 309, 558-64(1976)。此外,已知5,6-二氢吡喃酮衍生物可作为中间体:White, J. D., Brenner, J. B., Deinsdale, M. J., J. Amer. Chem. Soc. 93, 281-2(1971)。可用作作物保护剂的3-苯基-5,6-二氢吡喃酮衍生物在W001/98288中有记载。

[0014] 但是,这些化合物的药效及活性谱,特别是在低施用率及低浓度下,不总令人满意。此外,这些化合物与作物的相容性也并不总是足够。

[0015] 本发明现提供新的式(I)化合物

[0016]



[0017] 其中

[0018] J代表任选被取代的环烷基,该环烷基可任选被杂原子间断,

[0019] X代表氢、烷基、卤素、卤代烷基、烷氧基或卤代烷氧基,

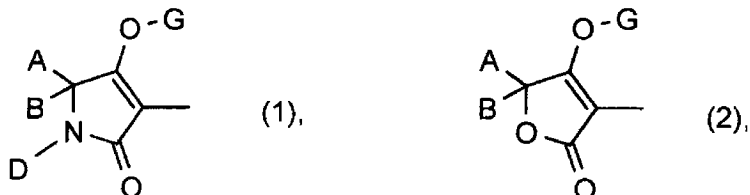
[0020] Y代表氢、烷基、卤代烷基、卤素、烷氧基或卤代烷氧基,

[0021] m代表数值1、2或3,

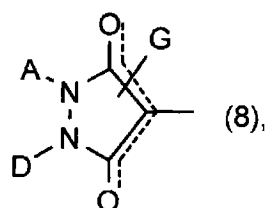
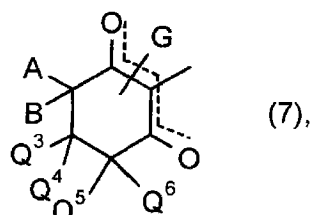
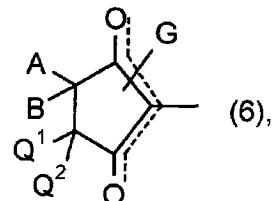
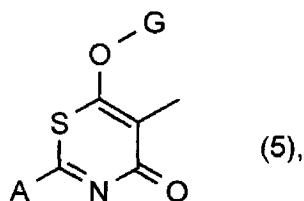
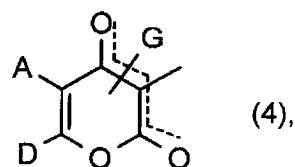
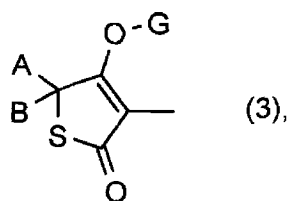
[0022] 条件是至少一个基团J、X或Y位于苯基基团的2位上并且不为氢,

[0023] CKE代表以下基团之一

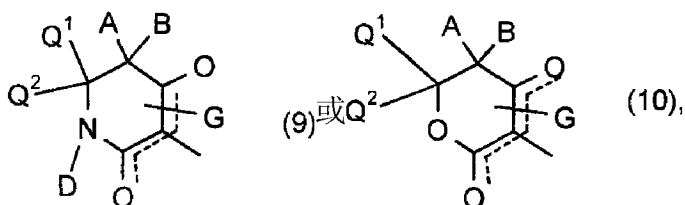
[0024]



[0025]



[0026]



[0027] 其中

[0028] A 代表氢,各自任选被卤素取代的烷基、烯基、烷氧基烷基、烷硫基烷基,其中任选地至少一个环原子被一个杂原子替代的饱和的或不饱和的、任选被取代的环烷基,或代表各自任选被卤素、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基、氰基或硝基取代的芳基、芳基烷基或杂芳基,

[0029] B 代表氢、烷基或烷氧基烷基,或

[0030] A 和 B 与它们所连接的碳原子一起代表任选含有至少一个杂原子的饱和的或不饱和的、未被取代的或被取代的环,

[0031] D 代表氢或一个任选被取代的下列基团:烷基、烯基、炔基、烷氧基烷基、其中任选地一个或多个环元素被杂原子替代的饱和的或不饱和的环烷基、芳基烷基、芳基、杂芳基烷基或杂芳基,或

[0032] A 和 D 与它们所连接的原子一起代表一个 A、D 部分上未被取代或被取代并且任选含有至少一个(在 CKE = 8 的情况下增加一个)杂原子的饱和的或不饱和的环,或

[0033] A 和 Q¹ 一起代表任选被一个羰基或被杂原子间断的烷二基或烯二基,其任选被卤素、羟基,各自任选被取代的烷基、烷氧基、烷硫基、环烷基、苄氧基或芳基取代,并且其中任选两个不直接相邻的碳原子形成另一个可任选被杂原子间断的任选被取代的环,或

[0034] D 和 Q¹ 与它们所连接的原子一起代表任选含有至少一个杂原子并且 D、Q¹ 部分上未被取代或被取代的饱和的或不饱和的环,

[0035] Q¹ 代表氢、烷基、烷氧基烷基、任选被取代的环烷基(其中任选地一个亚甲基被氧

或硫替代)或任选被取代的苯基,

[0036] Q^2 、 Q^4 、 Q^5 和 Q^6 相互独立地代表氢或烷基,

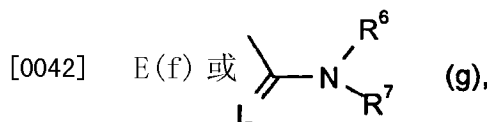
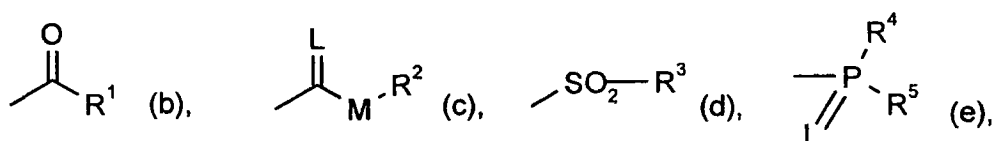
[0037] Q^3 代表氢,代表任选被取代的烷基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、任选被取代的环烷基(其中任选地一个亚甲基被氧或硫替代)或任选被取代的苯基,或

[0038] Q^1 和 Q^2 与它们所连接的碳原子一起代表任选含有一个杂原子的未被取代的或被取代的环,或

[0039] Q^3 和 Q^4 与它们所连接的碳原子一起代表任选含有一个杂原子的饱和的或不饱和的、未被取代的或被取代的环,

[0040] G 代表氢(a)或代表以下基团之一

[0041]



[0043] 其中

[0044] E 代表一种金属离子等价物或一种铵离子,

[0045] L 代表氧或硫,

[0046] M 代表氧或硫,

[0047] R^1 代表各自任选被卤素取代的烷基、烯基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、多烷氧基烷基或任选被卤素、烷基或烷氧基取代的环烷基,该环烷基可被至少一个杂原子间断;代表各自任选被取代的苯基、苯基烷基、杂芳基、苯氧基烷基或杂芳氧基烷基,

[0048] R^2 代表各自任选被卤素取代的烷基、烯基、烷氧基烷基、多烷氧基烷基,或代表各自任选被取代的环烷基、苯基或苄基,

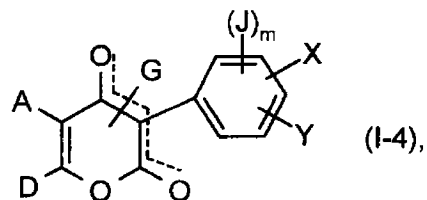
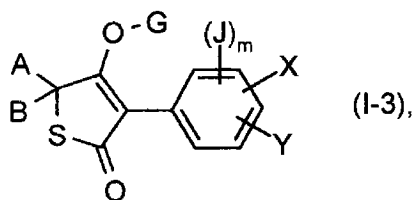
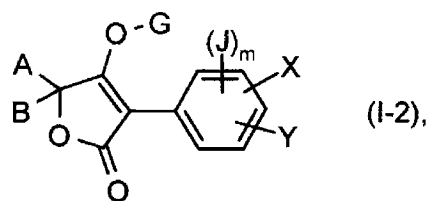
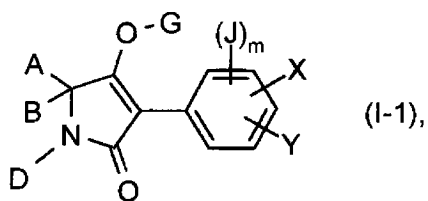
[0049] R^3 、 R^4 和 R^5 相互独立地代表各自任选被卤素取代的烷基、烷氧基、烷基氨基、二烷基氨基、烷硫基、烯基硫基、环烷基硫基,或代表各自任选被取代的苯基、苄基、苯氧基或苯硫基,

[0050] R^6 和 R^7 相互独立地代表氢,代表各自任选被卤素取代的烷基、环烷基、烯基、烷氧基、烷氧基烷基,代表任选被取代的苯基,代表任选被取代的苄基,或者与它们所连接的 N 原子一起代表任选被氧或硫间断的环。

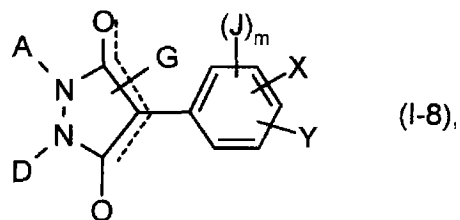
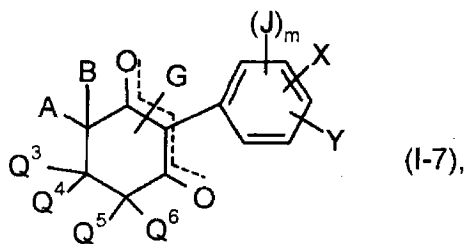
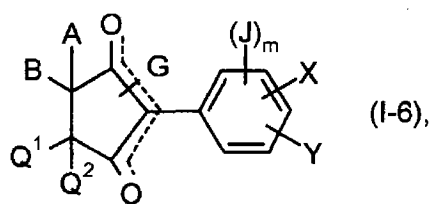
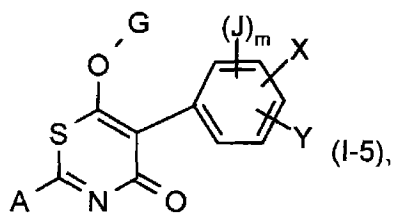
[0051] 尤其是根据取代基的性质等因素,式(I)的化合物可以几何异构体和/或光学异构体或不同组成的异构体混合物的形式而存在,如果合适,其可以常规方式进行分离。本发明提供纯异构体和异构体混合物、它们的制备方法和用途,及含有它们的组合物。但是,为简便起见,下文仅提及式(I)的化合物,尽管其含义不仅为纯化合物,并且如果合适还可为具有不同比例的异构体化合物的混合物。

[0052] 包括基团 CKE 的含义(1)-(10)在内,形成以下主要结构(I-1)-(I-10):

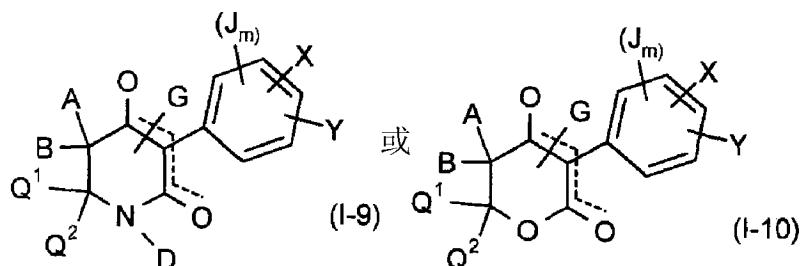
[0053]



[0054]



[0055]



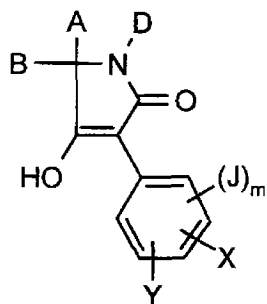
[0056] 其中

[0057] A、B、D、G、J、m、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X 和 Y 如上定义。

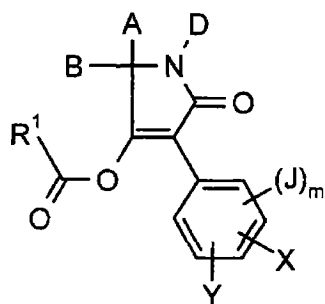
[0058] 如果 CKE 代表基团 (1), 则包括基团 G 的不同含义 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g) 在内, 形成以下主要结构 (I-1-a)-(I-1-g) :

[0059]

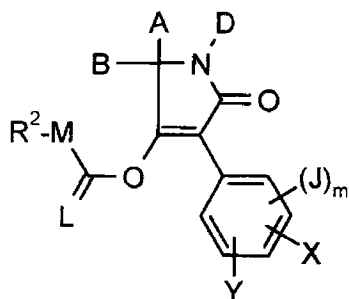
(I-1-a):



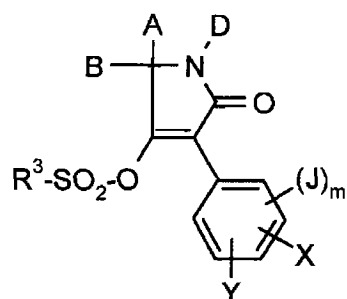
(I-1-b):



(I-1-c):

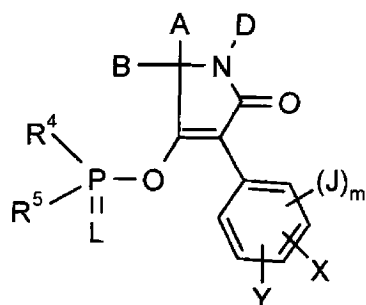


(I-1-d):

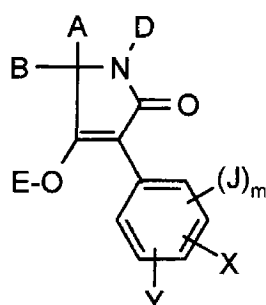


[0060]

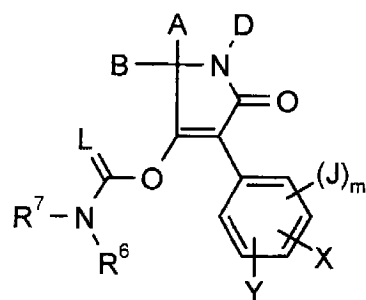
(I-1-e):



(I-1-f):



(I-1-g):



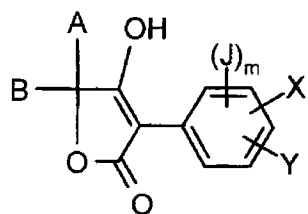
[0061] 其中

[0062] A、B、D、E、J、L、m、M、X、Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 和 R⁷ 如上定义。

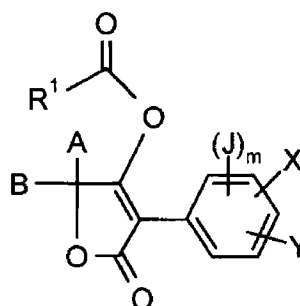
[0063] 如果 CKE 代表基团 (2), 则包括基团 G 的不同含义 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g) 在内, 形成以下主要结构 (I-2-a)-(I-2-g):

[0064]

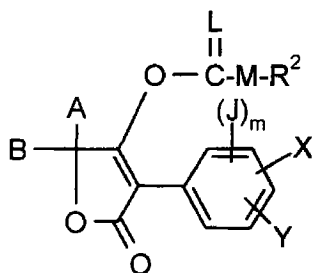
(I-2-a):



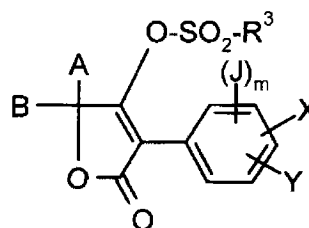
(I-2-b):



(I-2-c):

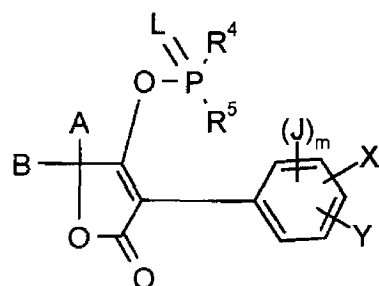


(I-2-d):

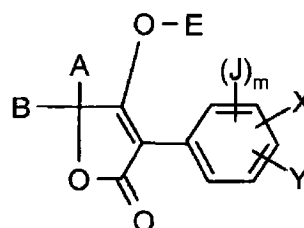


[0065]

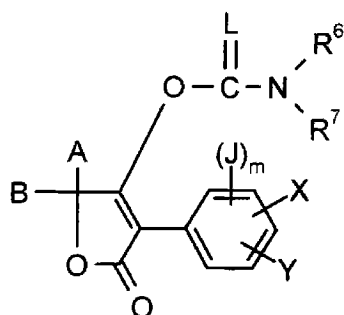
(I-2-e):



(I-2-f):



(I-2-g):



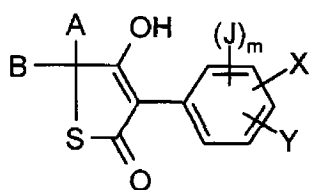
[0066] 其中

[0067] A、B、E、J、L、m、M、X、Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 和 R⁷ 如上定义。

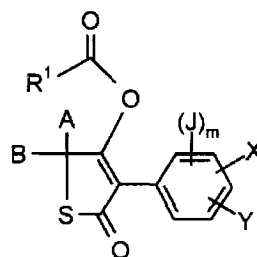
[0068] 如果 CKE 代表基团 (3), 则包括基团 G 的不同含义 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g) 在内, 形成以下主要结构 (I-3-a)-(I-3-g):

[0069]

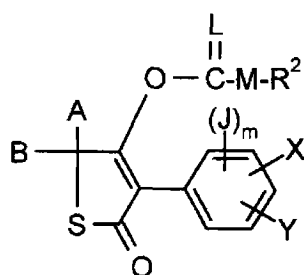
(I-3-a):



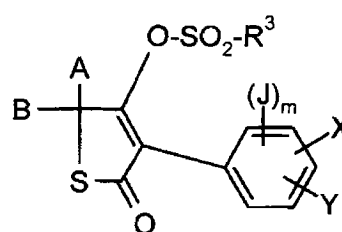
(I-3-b):



(I-3-c):

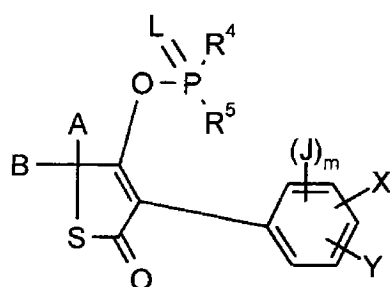


(I-3-d):

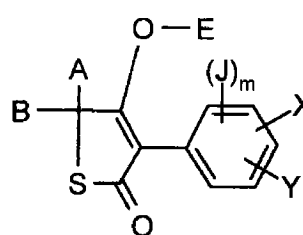


[0070]

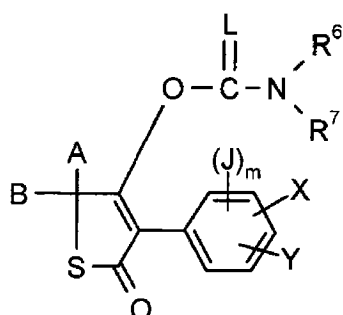
(I-3-e):



(I-3-f):



(I-3-g):

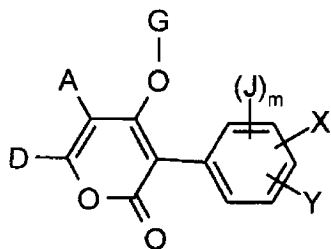


[0071] 其中

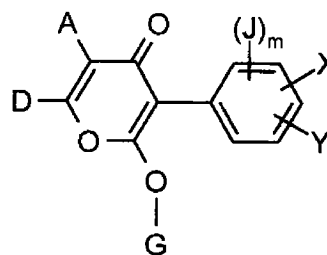
[0072] A、B、E、J、L、m、M、X、Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 和 R⁷ 如上定义。

[0073] 根据取代基 G 的位置, 式 (I-4) 的化合物可以式 (I-4-A) 和 (I-4-B) 两种异构体形式存在

[0074]



(I-4-A)



(I-4-B)

[0075] 其含义通过式 (I-4) 中的虚线表明。

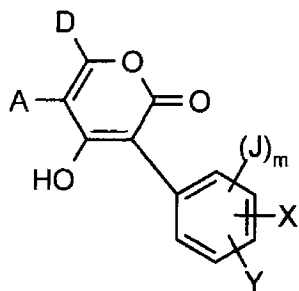
[0076] 式 (I-4-A) 和 (I-4-B) 的化合物可以混合物和其纯异构体的形式存在。如果合适，式 (I-4-A) 和 (I-4-B) 化合物的混合物可通过物理方法、例如色谱法以本身已知的方式进行分离。

[0077] 为清楚起见，下文中各种情况只示出一种可能的异构体。但这并不排除，如果合适，化合物以异构体混合物形式或以各自的其他异构体形式存在。

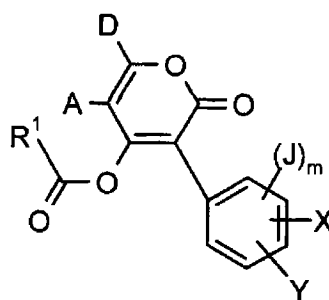
[0078] 如果 CKE 代表基团 (4)，则包括基团 G 的不同含义 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g) 在内，形成以下主要结构 (I-4-a)-(I-4-g)：

[0079]

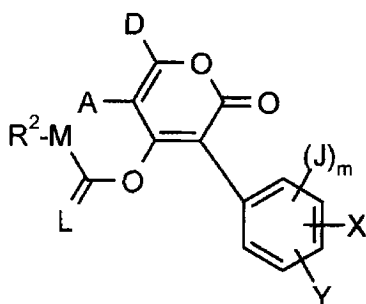
(I-4-a):



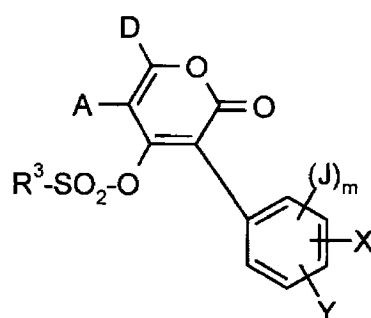
(I-4-b):



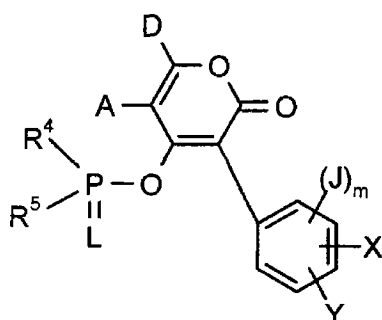
(I-4-c):



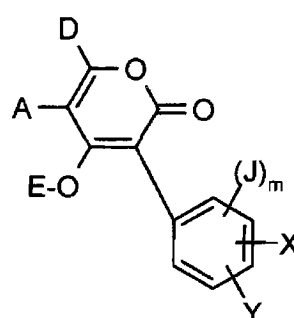
(I-4-d):



(I-4-e):

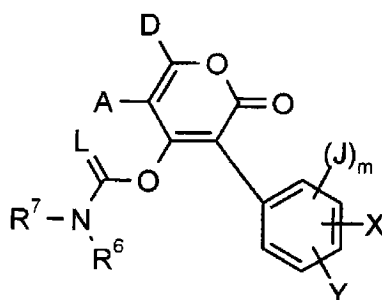


(I-4-f):



[0080]

(I-4-g):



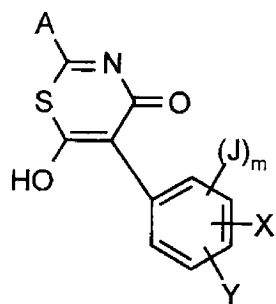
[0081] 其中

[0082] A、D、E、J、L、m、M、X、Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 和 R⁷ 如上定义。

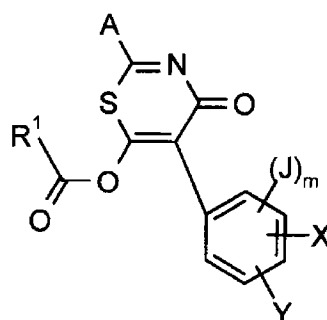
[0083] 如果 CKE 代表基团 (5), 则包括基团 G 的不同含义 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g) 在内, 形成以下主要结构 (I-5-a)-(I-5-g):

[0084]

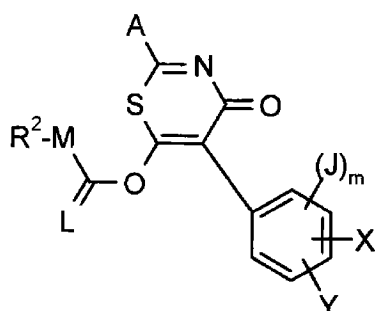
(I-5-a):



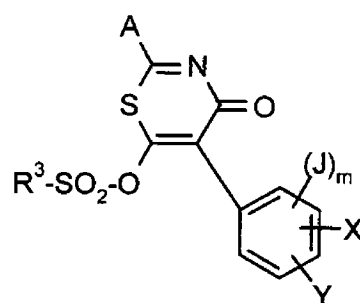
(I-5-b):



(I-5-c):

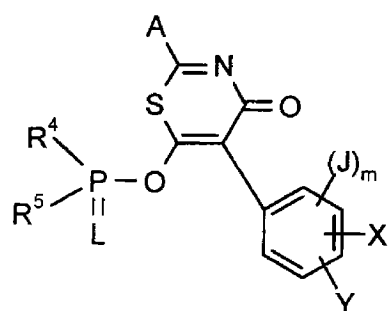


(I-5-d):

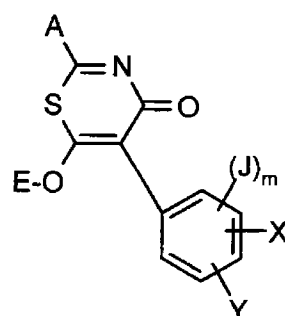


[0085]

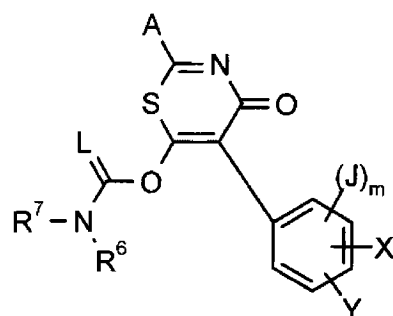
(I-5-e):



(I-5-f):



(I-5-g):

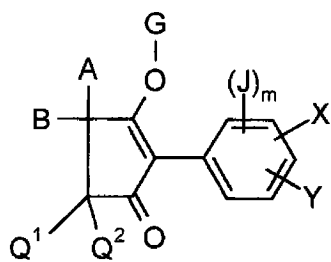
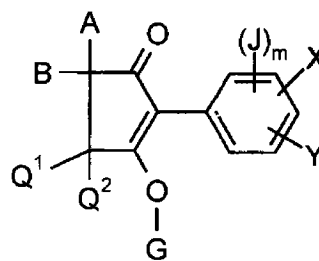


[0086] 其中

[0087] A、E、J、L、m、M、X、Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 和 R⁷ 如上定义。

[0088] 根据取代基 G 的位置, 式 (I-6) 的化合物可以式 (I-6-A) 和 (I-6-B) 两种异构体形式存在

[0089]

**(I-6-A)****(I-6-B)**

[0090] 其含义通过式 (I) 中的虚线指明。

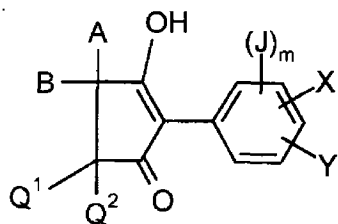
[0091] 式 (I-6-A) 和 (I-6-B) 的化合物可以混合物和以其纯异构体形式存在。如果合适，式 (I-6-A) 和 (I-6-B) 化合物的混合物可通过物理方法、例如色谱法进行分离。

[0092] 为清楚起见，下文中各种情况仅示出一种可能的异构体。这并不排除，如果合适，化合物可以异构体混合物形式或以各自的其他异构体形式存在。

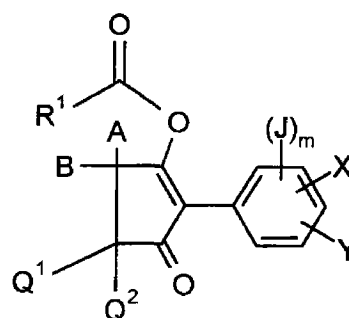
[0093] 包括基团 G 的不同含义 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g) 在内，形成以下主要结构 (I-6-a)-(I-6-g)：

[0094]

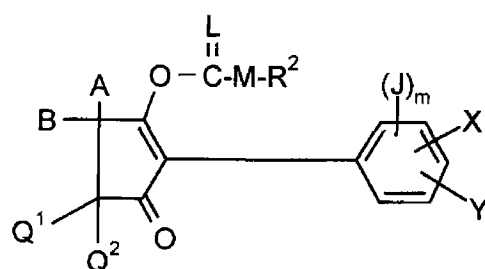
(I-6-a):



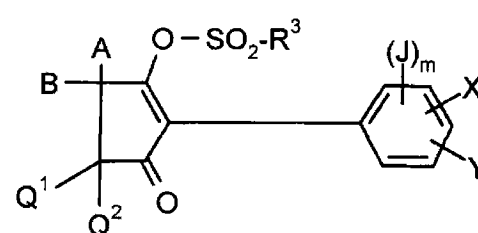
(I-6-b):



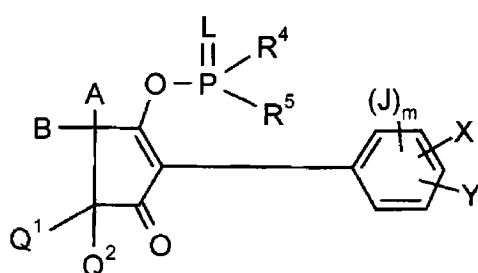
(I-6-c):



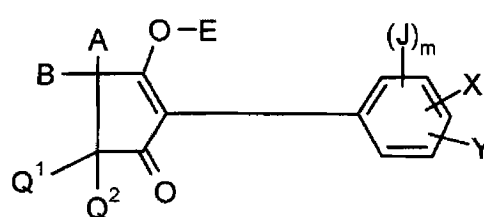
(I-6-d):



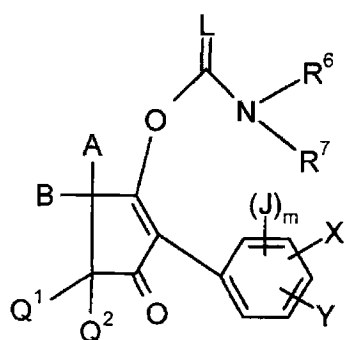
(I-6-e):



(I-6-f):



(I-6-g):

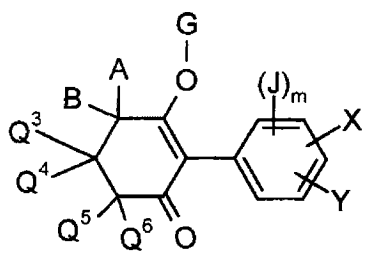
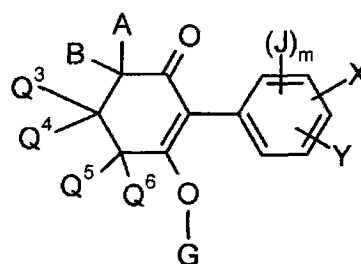


[0095] 其中

[0096] A、B、J、Q¹、Q²、E、L、m、M、X、Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 和 R⁷ 如上定义。

[0097] 根据取代基 G 的位置, 式 (I-7) 的化合物可以式 (I-7-A) 和 (I-7-B) 两种异构体的形式存在, 其含义通过式 (I-7) 中的虚线指明:

[0098]

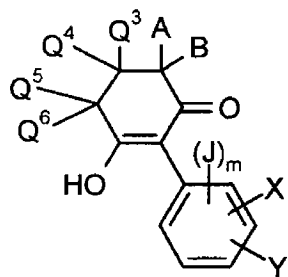
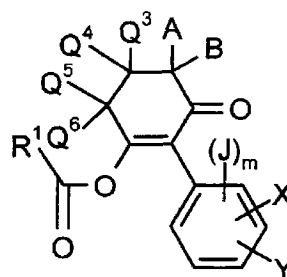
**(I-7-A)****(I-7-B)**

[0099] 式 (I-7-A) 和 (I-7-B) 的化合物可以混合物和以其纯异构体形式存在。如果合适, 式 (I-7-A) 和 (I-7-B) 化合物的混合物可通过物理方法、例如色谱法进行分离。

[0100] 为清楚起见, 下文中各种情况仅示出一种可能的异构体。这并不排除, 如果合适, 相关化合物可以异构体混合物形式或以各自的其他异构体形式存在。

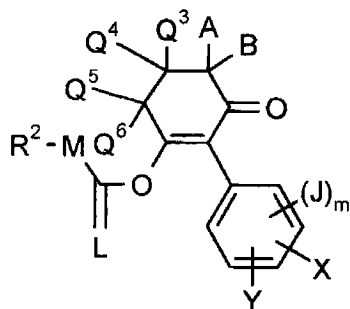
[0101] 包括基团 G 的不同含义 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g) 在内, 形成以下主要结构 (I-7-a)-(I-7-g) :

[0102]

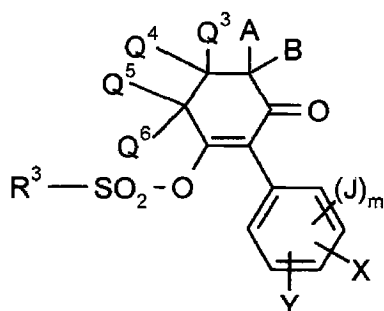
(I-7-a):**(I-7-b):**

[0103]

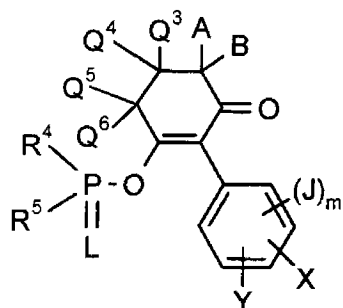
(I-7-c):



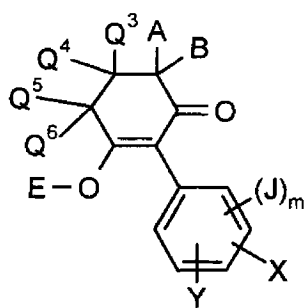
(I-7-d):



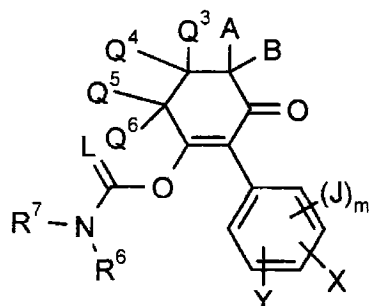
(I-7-e):



(I-7-f):



(I-7-g):

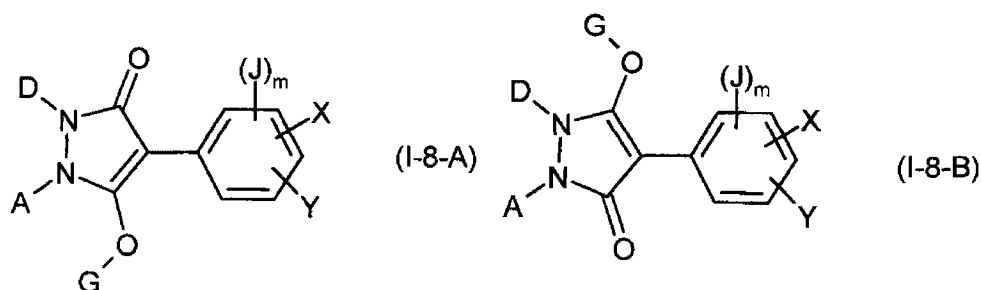


[0104] 其中

[0105] A、B、J、E、L、m、M、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X、Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 和 R⁷ 如上定义。

[0106] 根据取代基 G 的位置, 式 (I-8) 的化合物可以式 (I-8-A) 和 (I-8-B) 两种异构体形式存在

[0107]



[0108] 其含义通过式 (I-8) 中的虚线指明。

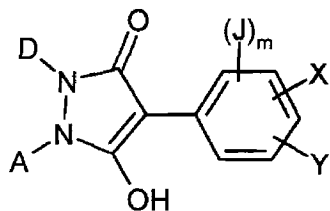
[0109] 式 (I-8-A) 和 (I-8-B) 的化合物可以混合物和以其纯异构体形式存在。如果合适, 式 (I-8-A) 和 (I-8-B) 化合物的混合物可通过物理方法、例如色谱法以本身已知的方式进行分离。

[0110] 为清楚起见,下文中各种情况仅示出一种可能的异构体。这并不排除,如果合适,化合物可以异构体混合物形式或以各自的其他异构体形式存在。

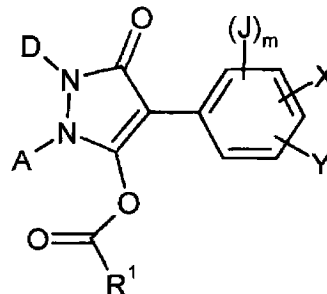
[0111] 如果 CKE 代表基团 (8),则包括基团 G 的不同含义 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g) 在内,形成以下主要结构 (I-8-a)-(I-8-g) :

[0112]

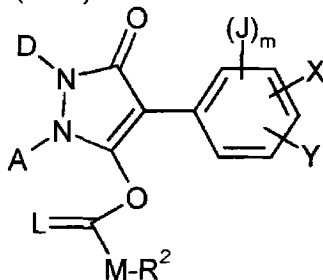
(I-8-a):



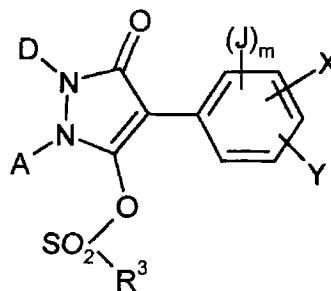
(I-8-b):



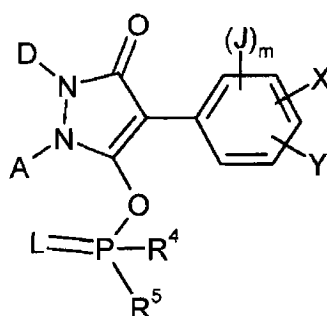
(I-8-c):



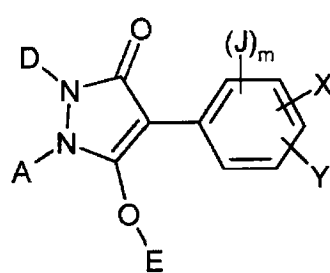
(I-8-d):



(I-8-e):

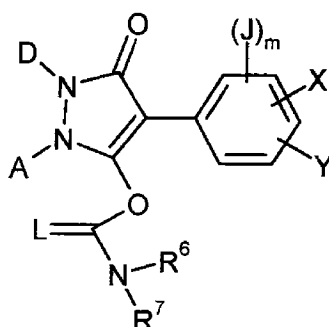


(I-8-f):



[0113]

(I-8-g):

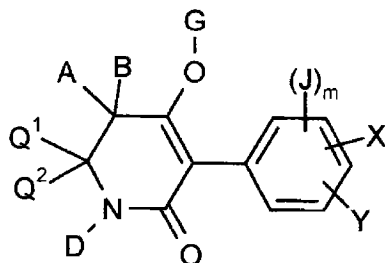


[0114] 其中

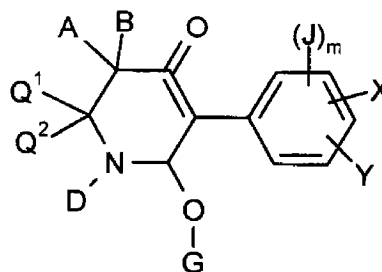
[0115] A、D、E、J、L、M、m、X、Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 和 R⁷ 如上定义。

[0116] 根据取代基 G 的位置, 式 (I-9) 的化合物可以式 (I-9-A) 和 (I-9-B) 两种异构体形式存在

[0117]



(I-9-A)



(I-9-B)

[0118] 其含义通过式 (I-9) 中的虚线指明。

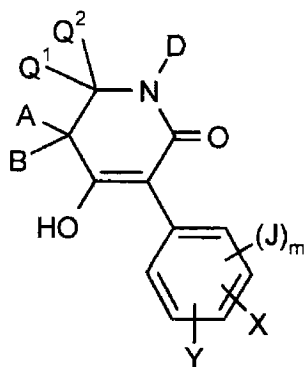
[0119] 式 (I-9-A) 和 (I-9-B) 的化合物可以混合物和以其纯异构体形式存在。如果合适, 式 (I-9-A) 和 (I-9-B) 化合物的混合物可通过物理方法、例如色谱法以本身已知的方式进行分离。

[0120] 为清楚起见, 下文中各种情况仅示出一种可能的异构体。这并不排除, 如果合适, 化合物可以异构体混合物形式或以各自的其他异构体形式存在。

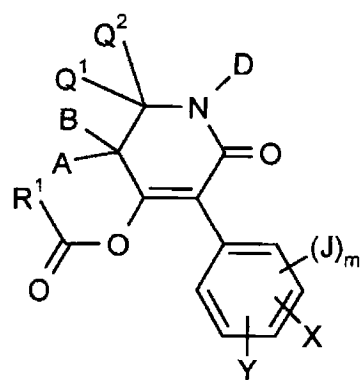
[0121] 如果 CKE 代表基团 (9), 则包括基团 G 的不同含义 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g) 在内, 形成以下主要结构 (I-9-a)-(I-9-g) :

[0122]

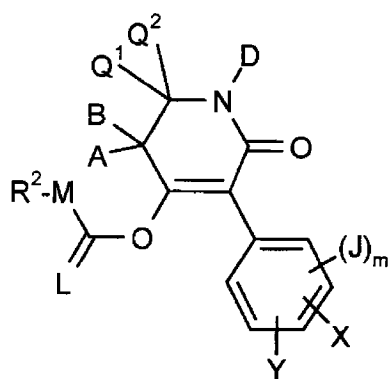
(I-9-a):



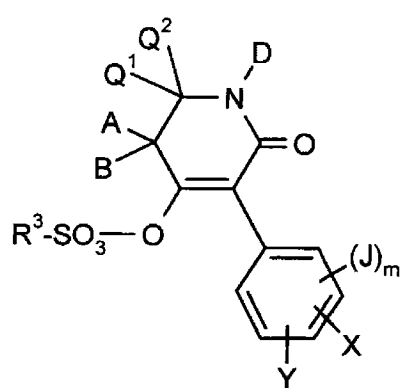
(I-9-b):



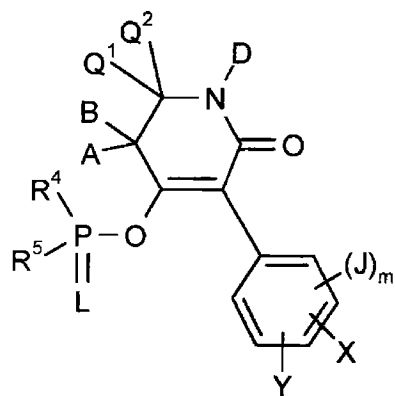
(I-9-c):



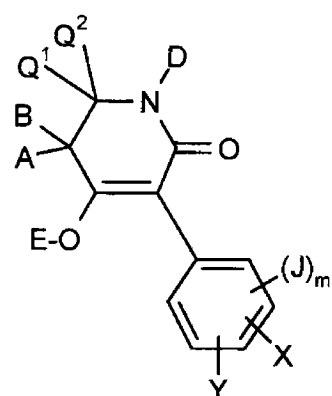
(I-9-d):



(I-9-e):

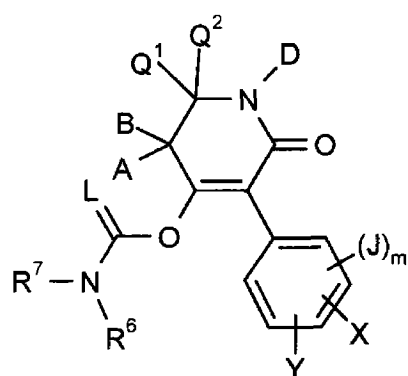


(I-9-f):



[0123]

(I-9-g):

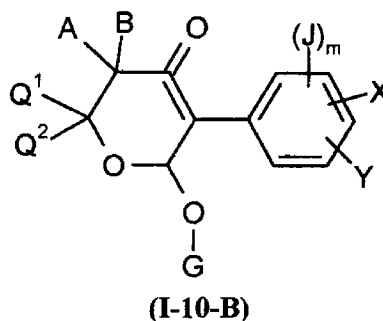
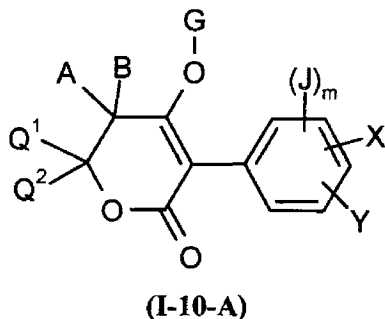


[0124] 其中

[0125] A、B、D、E、J、L、m、M、Q¹、Q²、X、Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 和 R⁷ 如上定义。

[0126] 根据取代基 G 的位置, 式 (I-10) 的化合物可以式 (I-10-A) 和 (I-10-B) 两种异构体形式存在

[0127]



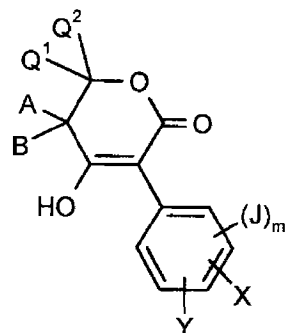
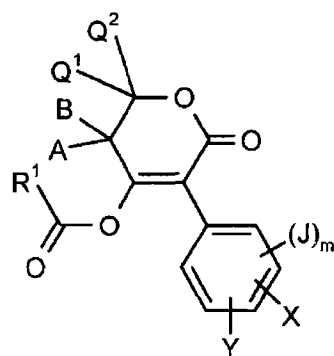
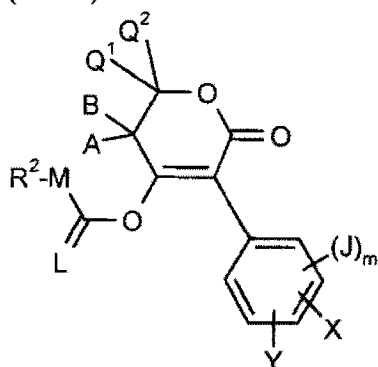
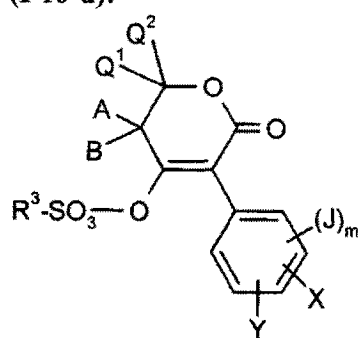
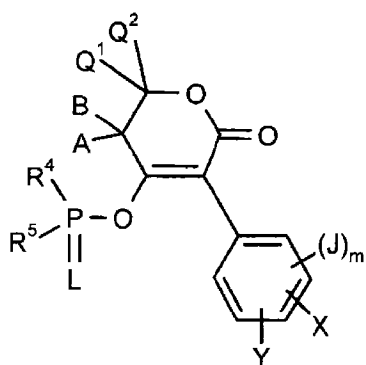
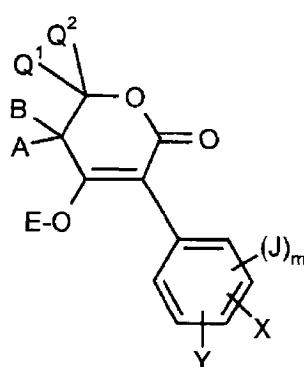
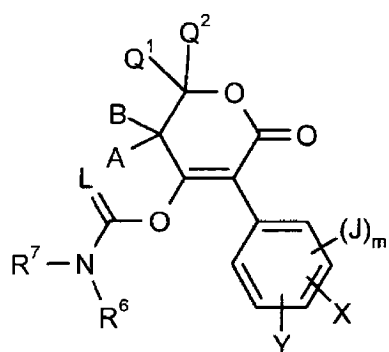
[0128] 其含义通过式 (I-10) 中的虚线指明。

[0129] 式 (I-10-A) 和 (I-10-B) 的化合物可以混合物和以其纯异构体的形式存在。如果合适, 式 (I-10-A) 和 (I-10-B) 化合物的混合物可通过物理方法、例如色谱法以本身已知的方式进行分离。

[0130] 为清楚起见, 下文中各种情况仅示出一种可能的异构体。这并不排除, 如果合适, 化合物可以异构体混合物形式或以各自的其他异构体形式存在。

[0131] 如果 CKE 代表基团 (10), 则包括基团 G 的不同含义 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g) 在内, 形成以下主要结构 (I-10-a)-(I-10-g) :

[0132]

(I-10-a):**(I-10-b):****(I-10-c):****(I-10-d):****(I-10-e):****(I-10-f):****(I-10-g):**

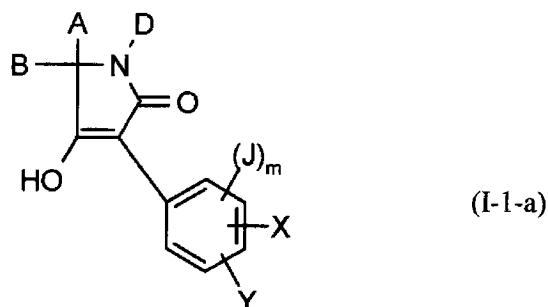
[0133] 其中

[0134] A、B、E、L、m、M、Q¹、Q²、X、Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 和 R⁷ 如上定义。

[0135] 此外,已发现,式(I)的新化合物通过下述方法之一获得:

[0136] (A) 式(I-1-a)的被取代的3-苯基吡咯烷-2,4-二酮或其烯醇,通过式(II)的N-酰基氨基酸酯在一种稀释剂的存在下并且在一种碱的存在下进行分子内缩合而获得,

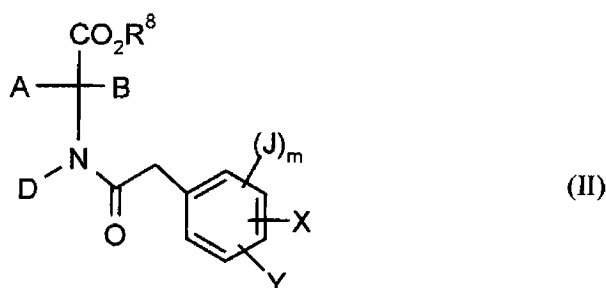
[0137]



[0138] 其中

[0139] A、B、D、J、m、X 和 Y 如上定义,

[0140]



[0141] 其中

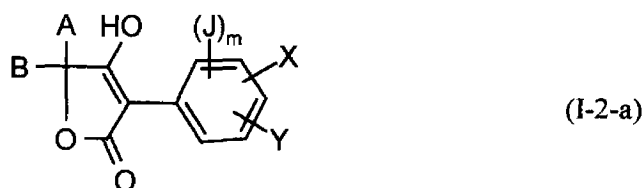
[0142] A、B、D、J、m、X 和 Y 如上定义,

[0143] 并且

[0144] R⁸ 代表烷基 (优选 C₁-C₆ 烷基)。

[0145] (B) 此外,已发现,式(I-2-a)的被取代的3-苯基-4-羟基-Δ³-二氢呋喃酮衍生物,通过式(III)的羧酸酯在一种稀释剂的存在下并且在一种碱的存在下进行分子内缩合而获得,

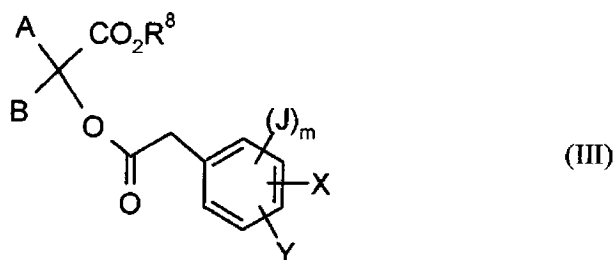
[0146]



[0147] 其中

[0148] A、B、J、m、X 和 Y 如上定义,

[0149]

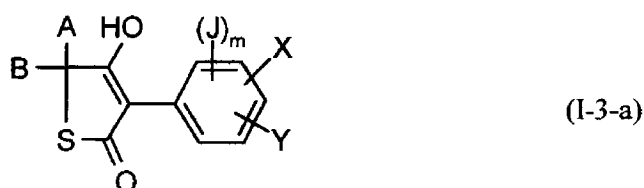


[0150] 其中

[0151] A、B、J、m、X、Y 和 R^8 如上定义。

[0152] (C) 此外, 已发现, 式 (I-3-a) 的被取代的 3- 苯基 -4- 羟基 - Δ^3 - 二氢噻吩酮衍生物, 通过式 (IV) 的 β - 酮羧酸酯进行分子内环化而获得, 反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且在一种酸的存在下进行,

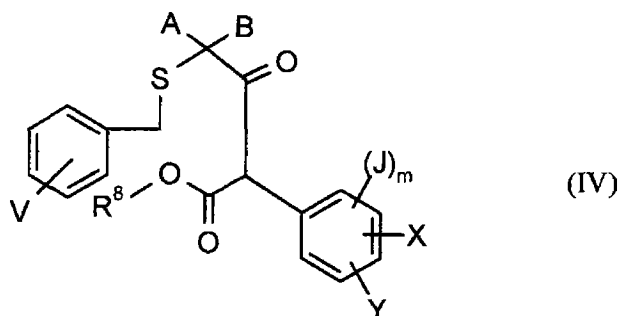
[0153]



[0154] 其中

[0155] A、B、J、m、X 和 Y 如上定义,

[0156]



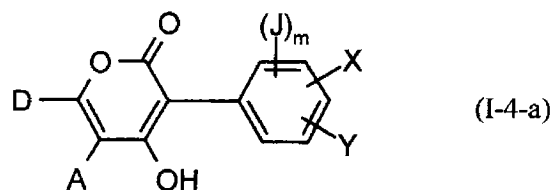
[0157] 其中

[0158] A、B、J、m、X、Y 和 R^8 如上定义, 并且

[0159] V 代表氢、卤素、烷基 (优选 C_1 - C_6 烷基) 或烷氧基 (优选 C_1 - C_8 烷氧基)。

[0160] (D) 此外, 已发现, 新的式 (I-4-a) 的被取代的 3- 苯基吡喃酮衍生物, 通过式 (V) 的羰基化合物或其式 (Va) 的甲硅烷基烯醇醚与式 (VI) 的烯酮酰卤进行反应而获得, 反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸受体的存在下进行,

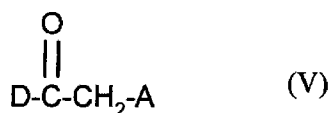
[0161]



[0162] 其中

[0163] A、D、J、m、X 和 Y 如上定义,

[0164]



[0165] 其中

[0166] A 和 D 如上定义，

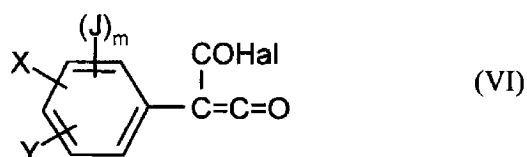
[0167]



[0168] 其中

[0169] A、D 和 R^8 如上定义，

[0170]



[0171] 其中

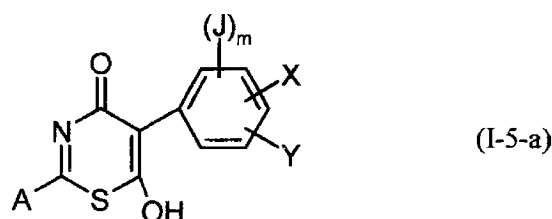
[0172] J、m、X 和 Y 如上定义，并且

[0173] Hal 代表卤素（优选氯或溴）。

[0174] 此外，已发现

[0175] (E) 新的式 (I-5-a) 的被取代的苯基-1,3-噻嗪衍生物，通过式 (VII) 的硫代酰胺与式 (VI) 的乙烯酮酰卤进行反应而获得，反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸受体的存在下进行，

[0176]



[0177] 其中

[0178] A、J、m、X 和 Y 如上定义，

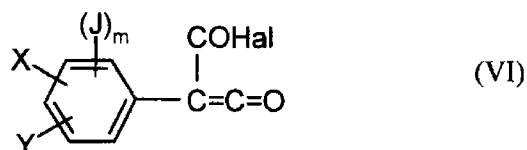
[0179]



[0180] 其中

[0181] A 如上定义，

[0182]



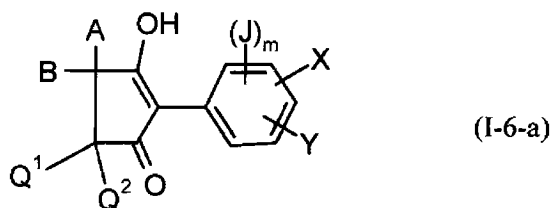
[0183] 其中

[0184] Hal、J、m、X 和 Y 如上定义。

[0185] 此外, 已发现

[0186] (F) 式 (I-6-a) 的化合物, 通过式 (VIII) 的酮羧酸酯进行分子内环化而获得, 反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且在一种碱的存在下进行,

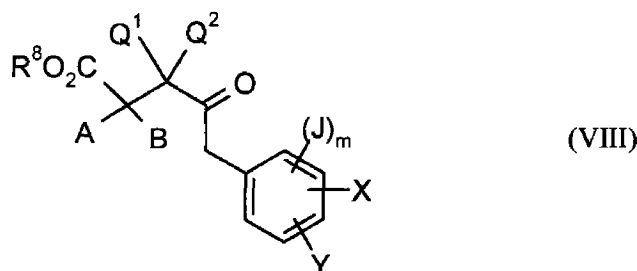
[0187]



[0188] 其中

[0189] A、B、Q¹、Q²、J、m、X 和 Y 如上定义,

[0190]



[0191] 其中

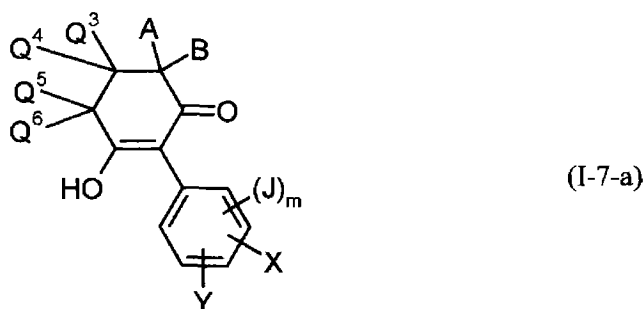
[0192] A、B、Q¹、Q²、J、m、X 和 Y 如上定义, 并且

[0193] R⁸ 代表烷基 (特别是 C₁-C₈ 烷基)。

[0194] 此外, 已发现

[0195] (G) 式 (I-7-a) 的化合物, 通过式 (IX) 的 6-芳基-5-酮己酸酯在一种稀释剂的存在下并且在一种碱的存在下进行分子内缩合而获得,

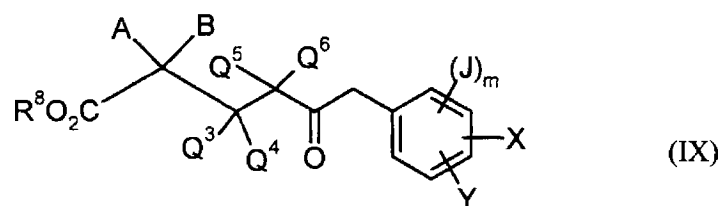
[0196]



[0197] 其中

[0198] A、B、J、m、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X 和 Y 如上定义,

[0199]



[0200] 其中

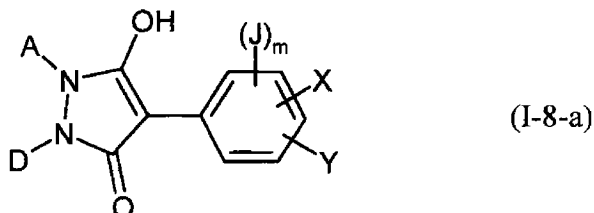
[0201] A、B、J、m、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X 和 Y 如上定义，

[0202] 并且

[0203] R⁸ 代表烷基（优选 C₁-C₆ 烷基）。

[0204] (H) 此外，已发现，式 (I-8-a) 的化合物，通过式 (X) 的化合物

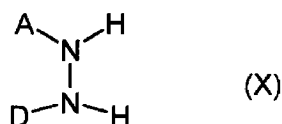
[0205]



[0206] 其中

[0207] A、D、J、m、X 和 Y 如上定义，

[0208]



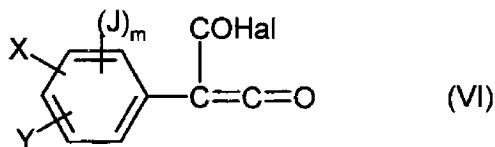
[0209] 其中

[0210] A 和 D 如上定义，

[0211] 与以下物质反应而获得，

[0212] α) 与式 (VI) 的化合物反应，该反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸受体的存在下进行，

[0213]



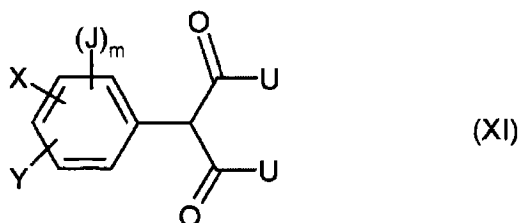
[0214] 其中

[0215] Hal、m、X、Y 和 J 如上定义，

[0216] 或者

[0217] β) 与式 (XI) 的化合物反应，该反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种碱的存在下进行，

[0218]



[0219] 其中

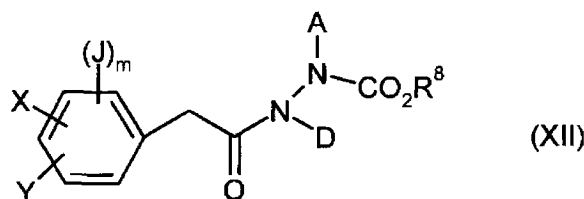
[0220] J、m、X 和 Y 如上定义

[0221] 并且 U 代表 NH₂ 或 O-R⁸，其中 R⁸ 如上定义，

[0222] 或者

[0223] γ) 与式 (XII) 的化合物反应, 该反应如果合适在一种稀释剂的存在下 并且如果合适在一种碱的存在下进行,

[0224]



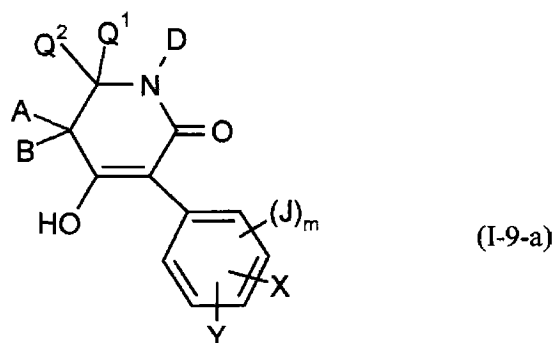
[0225] 其中

[0226] A、D、J、m、X、Y 和 R^8 如上定义。

[0227] 此外, 已发现新的式 (I) 化合物通过下述方法之一获得:

[0228] (I) 式 (I-9-a) 的被取代的四氢吡啶-2,4-二酮或其烯醇, 通过式 (XIII) 的 N-酰基氨基酸酯在一种稀释剂的存在下并且在一种碱的存在下进行分子内缩合而获得,

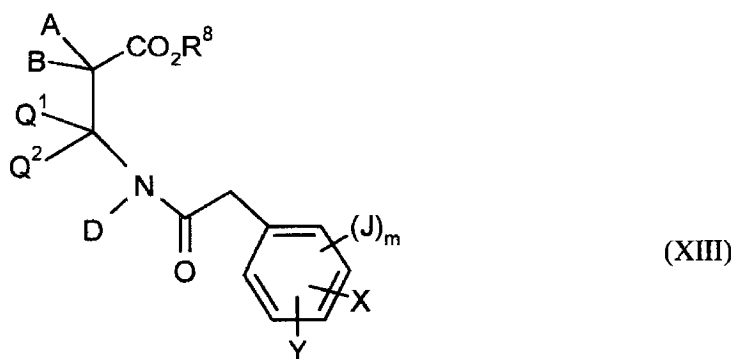
[0229]



[0230] 其中

[0231] A、B、D、J、m、 Q^1 、 Q^2 、X 和 Y 如上定义,

[0232]



[0233] 其中

[0234] A、B、D、J、m、 Q^1 、 Q^2 、X 和 Y 如上定义,

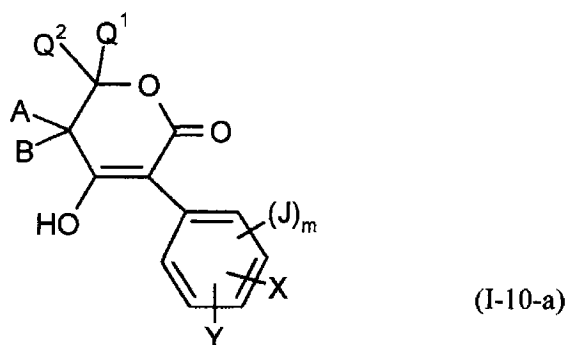
[0235] 并且

[0236] R^8 代表烷基 (优选 C_1 - C_6 烷基)。

[0237] 此外, 已发现

[0238] (J) 式 (I-10-a) 的被取代的 5,6-二氢吡喃酮, 通过式 (XIV) 的 O-酰基羟基羧酸酯在一种稀释剂的存在下并且在一种碱的存在下进行分子内缩合而获得,

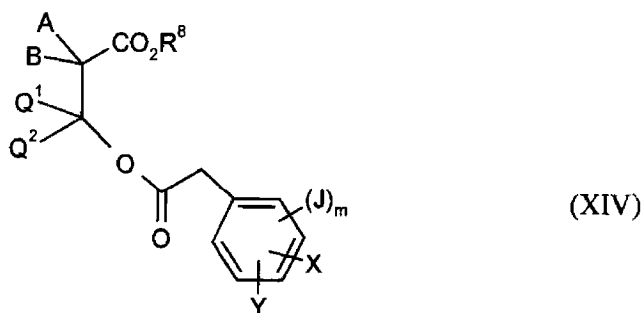
[0239]



[0240] 其中

[0241] A、B、J、m、Q¹、Q²、X 和 Y 如上定义，

[0242]



[0243] 其中

[0244] A、B、J、m、Q¹、Q²、X 和 Y 如上定义，

[0245] 并且

[0246] R⁸ 代表烷基（优选 C₁-C₆ 烷基）。

[0247] 此外，已发现

[0248] (K) 上面所示式 (I-1-b)-(I-10-b) 的化合物——式中 A、B、D、J、m、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、R¹、X 和 Y 如上定义，通过上面所示式 (I-1-a)-(I-10-a) 的化合物——式中 A、B、D、J、m、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X 和 Y 如上定义，各自与以下物质反应而获得，

[0249] (α) 与式 (XV) 的酰卤 (acid halide) 反应

[0250]



[0251] 其中

[0252] R¹ 如上定义，并且

[0253] Hal 代表卤素（特别是氯和溴）

[0254] 或者

[0255] (β) 与式 (XVI) 的羧酸酐反应，该反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行，

[0256] R¹-CO-O-CO-R¹ (XVI)

[0257] 其中

[0258] R¹ 如上定义；

[0259] (L) 上面所示式 (I-1-c)-(I-10-c) 的化合物——式中 A、B、D、J、m、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、

Q^6 、 R^2 、M、X 和 Y 如上定义并且 L 代表氧,通过上面所示式 (I-1-a)-(I-10-a) 的化合物——式中 A、B、D、J、m、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、X 和 Y 如上定义,各自与式 (XVII) 的氯甲酸酯或氯甲酸硫酯反应而获得,该反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行,



[0261] 其中

[0262] R^2 和 M 如上定义;

[0263] (M) 上面所示式 (I-1-c)-(I-10-c) 的化合物——式中 A、B、D、J、m、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 R^2 、M、X 和 Y 如上定义并且 L 代表硫,通过上面所示式 (I-1-a)-(I-10-a) 的化合物——式中 A、B、D、J、m、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、X 和 Y 如上定义,各自与式 (XVIII) 的氯—硫代甲酸酯或氯二硫代甲酸酯反应而获得,该反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行,

[0264]



[0265] 其中

[0266] M 和 R^2 如上定义,

[0267] 并且

[0268] (N) 上面所示式 (I-1-d)-(I-10-d) 的化合物——式中 A、B、D、J、m、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 R^3 、X 和 Y 如上定义,通过上面所示式 (I-1-a)-(I-10-a) 的化合物——式中 A、B、D、J、m、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、X 和 Y 如上定义,各自与式 (XIX) 的磺酰氯反应而获得,该反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行,



[0270] 其中

[0271] R^3 如上定义,

[0272] (O) 上面所示式 (I-1-e)-(I-10-e) 的化合物——式中 A、B、D、J、m、L、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 R^4 、 R^5 、X 和 Y 如上定义,通过上面所示式 (I-1-a)-(I-10-a) 的化合物——式中 A、B、D、J、m、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、X 和 Y 如上定义,各自与式 (XX) 的磷化合物反应而获得,该反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行,

[0273]



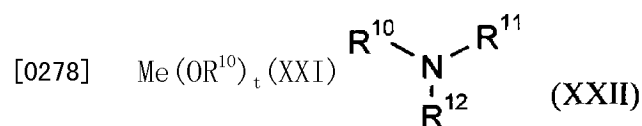
[0274] 其中

[0275] L、 R^4 和 R^5 如上定义,并且

[0276] Hal 代表卤素 (特别是氯或溴),

[0277] (P) 上面所示式 (I-1-f)-(I-10-f) 的化合物——式中 A、B、D、E、J、m、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、X 和 Y 如上定义,通过式 (I-1-a)-(I-10-a) 的化合物——式中 A、B、D、J、m、 Q^1 、

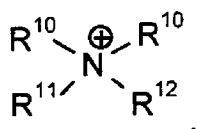
Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 X 和 Y 如上定义,各自与式 (XXI) 或式 (XXII) 的金属化合物或胺反应而获得,该反应如果合适在一种稀释剂的存在下进行,



[0279] 其中

[0280] Me 代表一价或二价金属 (优选碱金属或碱土金属,例如锂、钠、钾、镁或钙),或者代表一种铵离子

[0281]



[0282] t 代表数值 1 或 2,并且

[0283] R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 相互独立地代表氢或烷基 (优选 C_1 - C_8 烷基),

[0284] (Q) 上面所示式 (I-1-g)-(I-10-g) 的化合物——式中 A 、 B 、 D 、 J 、 m 、 L 、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 R^6 、 R^7 、 X 和 Y 如上定义,通过上面所示式 (I-1-a)-(I-10-a) 的化合物——式中 A 、 B 、 D 、 J 、 m 、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 X 和 Y 如上定义,各自与以下物质反应而获得,

[0285] (α) 与 (XXIII) 的异氰酸酯或异硫氰酸酯反应,该反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种催化剂的存在下进行,



[0287] 其中

[0288] R^6 和 L 如上定义,

[0289] 或者

[0290] (β) 与 (XXIV) 的氨基甲酰氯或硫代氨基甲酰氯反应,该反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行,

[0291]



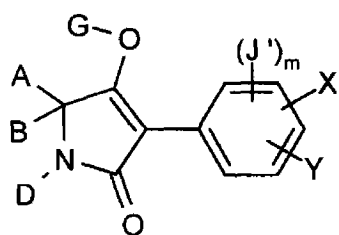
[0292] 其中

[0293] L 、 R^6 和 R^7 如上定义,

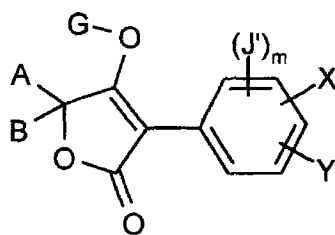
[0294] (R) 上面所示式 (I-1-g)-(I-10-g) 的化合物——式中 A 、 B 、 D 、 G 、 J 、 m 、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 X 和 Y 如上定义,通过式 (I-1')-(I-10'-g) 的化合物——式中 A 、 B 、 D 、 G 、 m 、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 X 和 Y 如上定义并且 J' 优选代表溴或碘,在一种溶剂的存在下、在一种催化剂 (例如 Pd 复合物) 的存在下和在一种碱 (例如碳酸钠、磷酸二氢钾) 的存在下与能够耦合的环烷基硼酸衍生物,例如式 (XXV) 的环烷基硼酸或其酯耦合而获得,

[0295]

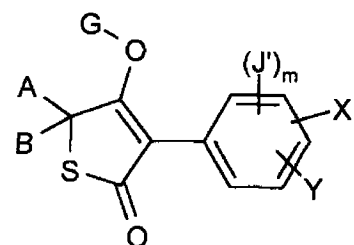
[0296]



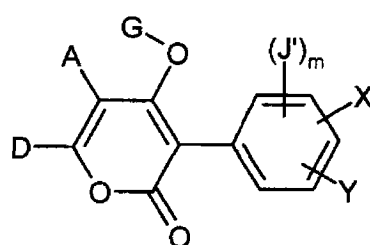
(I-1'),



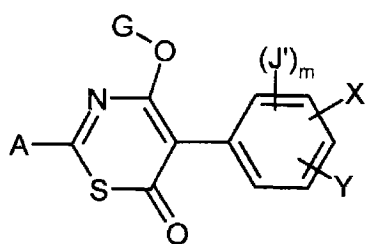
(I-2'),



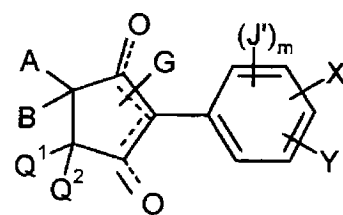
(I-3'),



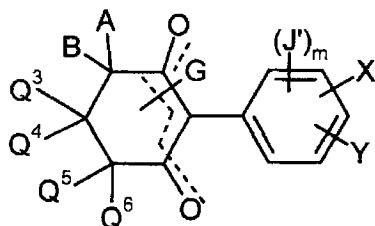
(I-4'),



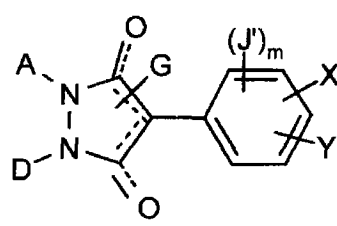
(I-5'),



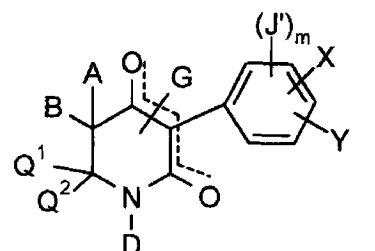
(I-6'),



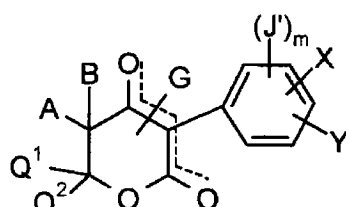
(I-7'),



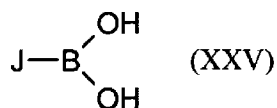
(I-8'),



(I-9'),



(I-10'),



(XXV)

[0297] 此外,已发现新的式(I)化合物作为杀虫剂、优选作为杀昆虫剂和/或杀螨剂和/或除草剂具有极好的活性。

[0298] 令人惊讶的是,现还发现某些被取代的环状酮-烯醇,当与下述改进作物植物相容性的化合物(安全剂/解毒剂)一起施用,能极好地防止对作物植物的破坏并且可作为光谱结合物产品特别有利地用于选择性防治有用植物作物中,例如,谷类以及玉米、大豆和稻中不想要的植物。

[0299] 本发明还提供含有有效量的活性化合物结合物的选择性除草组合物,所述活性化合物结合物含有以下组分,

[0300] (a') 至少一种被取代的式(I) 环状酮-烯醇,式中 CKE、J、m、X 和 Y 如上定义,

[0301] 和

[0302] (b') 至少一种改进作物植物相容性的化合物,该化合物是选自以下组的化合物:

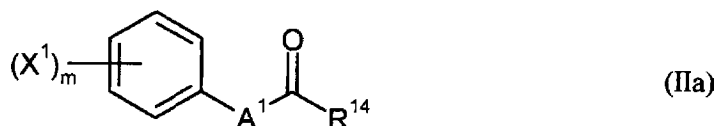
[0303] 4-二氯乙酰基-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5] 癸烷(AD-67, MON-4660)、1-二氯乙酰基六氢-3,3,8a-三甲基吡咯并[1,2-a]-嘧啶-6(2H)-酮(dicyclonon, BAS-145138)、4-二氯乙酰基-3,4-二氢-3-甲基-2H-1,4-苯并噁嗪(解草嗪(benoxacor))、5-氯喹啉-8-氧代乙酸1-甲基己基酯(解草酯(cloquintocet-mexyl)——另外参见 EP-A-86750、EP-A-94349、EP-A-191736、EP-A-492366 中的相关化合物)、3-(2-氯苄基)-1-(1-甲基-1-苯基乙基)脲(苄草隆(cumyluron))、 α -(氰基甲氧亚氨基)-苯基乙腈(解草胺腈(cyometrinil))、2,4-二氯苯氧基乙酸(2,4-D)、4-(2,4-二氯苯氧基)丁酸(2,4-DB)、1-(1-甲基-1-苯基乙基)-3-(4-甲基苯基)脲(杀草隆(daimuron, dymron))、3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸(麦草畏(dicamba))、S-1-甲基-1-苯基乙基哌啶-1-硫代羧酸酯(哌草丹(dimepiperate))、2,2-二氯-N-(2-氧代-2-(2-丙烯基氨基)乙基)-N-(2-丙烯基)乙酰胺(DKA-24)、2,2-二氯-N,N-二-2-丙烯基乙酰胺(烯丙酰草胺(dichlormid))、4,6-二氯-2-苯基嘧啶(解草啶(fenclorim))、1-(2,4-二氯苄基)-5-三氯甲基-1H-1,2,4-三唑-3-羧酸乙酯(解草唑(fenchlorazole-ethyl)——另外参见 EP-A-174562 和 EP-A-346620 中的相关化合物)、2-氯-4-三氟甲基噻唑-5-羧酸苯基甲基酯(解草胺(flurazole))、4-氯-N-(1,3-二氧戊环-2-基甲氧基)- α -三氟苯乙酮肟(氟草肟(fluxofenim))、3-二氯乙酰基-5-(2-呋喃基)-2,2-二甲基噁唑烷(解草恶唑(furilazole), MON-13900)、4,5-二氢-5,5-二苯基-3-异噁唑羧酸乙酯(双苯噁唑酸(isoxadifen-ethyl)——另外参见 WO-A-95/07897 中的相关化合物)、1-(乙氧基羰基)乙基 3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸酯(lactidichlor)、(4-氯-o-甲苯氧基)乙酸(MCPA)、2-(4-氯-o-甲苯氧基)丙酸(2 甲 4 氯丙酸(mecoprop))、1-(2,4-二氯苄基)-4,5-二氢-5-甲基-1H-吡唑-3,5-二羧酸二乙酯(吡唑解草酯(mefenpyr-diethyl)——另外参见 WO-A-91/07874 中的相关化合物)、2-二氯甲基-2-甲基-1,3-二氧戊环(MG-191)、2-丙烯基-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5] 癸烷-4-二硫代羧酸酯(MG-838)、1,8-萘二甲酸酐、 α -(1,3-二氧戊环-2-基甲氧亚氨基)苯基乙腈(解草腈(oxabetrinil))、2,2-二氯-N-(1,3-二氧戊环-2-基甲基)-N-(2-丙烯基)乙酰胺(PPG-1292)、3-二氯乙酰基-2,2-二甲基噁唑烷(R-28725)、3-二氯乙酰基-2,2,5-三甲基噁唑烷(R-29148)、4-(4-氯-o-甲苯基)丁酸、4-(4-氯苯氧基)丁酸、二苯基甲氧基乙酸、二苯基甲氧基乙酸甲酯、二苯基甲氧基乙酸乙酯、1-(2-氯苄基)-5-苯基-1H-吡唑-3-羧酸甲酯、1-(2,4-二氯苄基)-5-甲基-1H-吡唑-3-羧酸乙酯、1-(2,4-二氯苄基)-5-异丙基-1H-吡唑-3-羧酸乙酯、1-(2,4-二氯苄基)-5-(1,1-二甲基乙基)-1H-吡唑-3-羧酸乙酯、1-(2,4-二氯苄基)-5-苯基-1H-吡唑-3-羧酸乙酯(另外参见 EP-A-269806 和 EP-A-333131 中的相关化合物)、5-(2,4-二氯苄基)-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯、5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯、5-(4-氟苄基)-5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯(另外参见 WO-A-91/08202 中的相关化合物)、1,3-二甲基丁-1-基 5-氯喹

啉-8-氧基乙酸酯、4-烯丙氧基丁基 5-氯喹啉-8-氧基乙酸酯、1-烯丙氧基丙-2-基 5-氯喹啉-8-氧基乙酸酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸甲酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸乙酯、5-氯喹啉-8-氧基乙酸烯丙酯、2-氧代丙-1-基 5-氯喹啉-8-氧基乙酸酯、5-氯喹啉-8-氧基丙二酸二乙酯、5-氯喹啉-8-氧基丙二酸二烯丙酯、5-氯喹啉-8-氧基丙二酸二乙酯（另外参见 EP-A-582198 中的相关化合物）、4-羧基苯并二氢吡喃-4-基乙酸（AC-304415，参见 EP-A-613618）、4-氯苯氧基乙酸、3,3'-二甲基-4-甲氧基二苯甲酮、1-溴-4-氯甲基磺酰基苯、1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨磺酰基)苯基]-3-甲基脲（也称为 N-(2-甲氧基苯甲酰基)-4-[(甲基氨基羰基)氨基]苯磺酰胺）、1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨磺酰基)苯基]-3,3-二甲基脲、1-[4-(N-4,5-二甲基苯甲酰基氨磺酰基)苯基]-3-甲基脲、1-[4-(N-萘基氨磺酰基)苯基]-3,3-二甲基脲、N-(2-甲氧基-5-甲基苯甲酰基)-4-(环丙基氨基羰基)苯磺酰胺，

[0304] 和 / 或由以下通式定义的化合物中的一种：

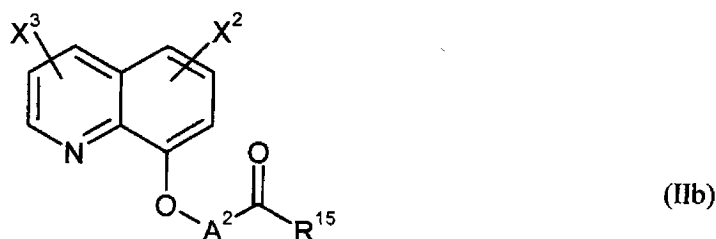
[0305] 通式 (IIa)

[0306]



[0307] 或通式 (IIb)

[0308]



[0309] 或通式 (IIc)

[0310]

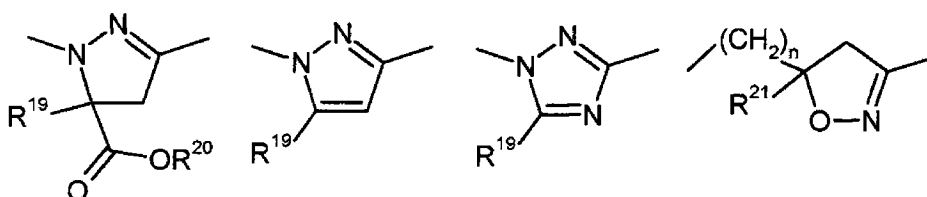


[0311] 其中

[0312] m 代表数值 0、1、2、3、4 或 5，

[0313] A¹ 代表以下所示二价杂环基团之一

[0314]



[0315] n 代表数值 0、1、2、3、4 或 5，

[0316] A² 代表任选被 C₁-C₄ 烷基和 / 或 C₁-C₄ 烷氧基羰基和 / 或 C₁-C₄ 烯氧基羰基取代的

具有 1 或 2 个碳原子的烷二基，

[0317] R^{14} 代表羟基、巯基、氨基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷基氨基或二 (C_1-C_4 烷基) 氨基，

[0318] R^{15} 代表羟基、巯基、氨基、 C_1-C_7 烷氧基、 C_1-C_6 烯氧基、 C_1-C_6 烯氧基- C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷基氨基或二 (C_1-C_4 烷基) 氨基，

[0319] R^{16} 代表各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C_1-C_4 烷基，

[0320] R^{17} 代表氢，各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基或 C_2-C_6 炔基， C_1-C_4 烷氧基- C_1-C_4 烷基、二氧戊环基- C_1-C_4 烷基、呋喃基、呋喃基- C_1-C_4 烷基、噻吩基、噻唑基、哌啶基，或任选被氟、氯和 / 或溴或者 C_1-C_4 烷基取代的苯基，

[0321] R^{18} 代表氢，各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基或 C_2-C_6 炔基， C_1-C_4 烷氧基- C_1-C_4 烷基、二氧戊环基- C_1-C_4 烷基、呋喃基、呋喃基- C_1-C_4 烷基、噻吩基、噻唑基、哌啶基，或任选被氟、氯和 / 或溴或者 C_1-C_4 烷基取代的苯基，

[0322] R^{17} 和 R^{18} 还一起代表各自任选被 C_1-C_4 烷基、苯基、呋喃基、稠合苯环取代或被两个与其所连接的 C 原子一起形成一个 5 元或 6 元碳环的取代基取代的 C_3-C_6 烷二基或 C_2-C_5 氧杂烷二基，

[0323] R^{19} 代表氢、氰基、卤素，或者代表各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C_1-C_4 烷基、 C_3-C_6 环烷基或苯基，

[0324] R^{20} 代表氢，任选被羟基、氰基、卤素或 C_1-C_4 烷氧基取代的 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 环烷基或三 (C_1-C_4 烷基) 甲硅烷基，

[0325] R^{21} 代表氢、氰基、卤素，或者代表各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的 C_1-C_4 烷基、 C_3-C_6 环烷基或苯基，

[0326] X^1 代表硝基、氰基、卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 卤代烷氧基，

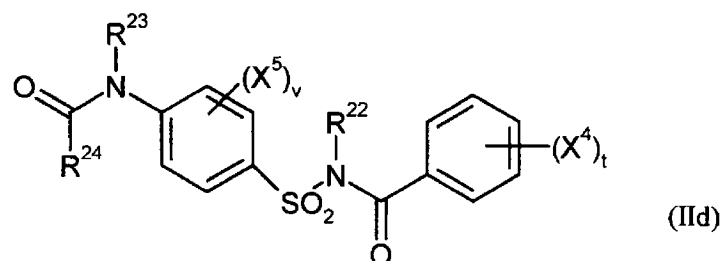
[0327] X^2 代表氢、氰基、硝基、卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 卤代烷氧基，

[0328] X^3 代表氢、氰基、硝基、卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 卤代烷氧基，

[0329] 和 / 或选自以下通式定义的化合物：

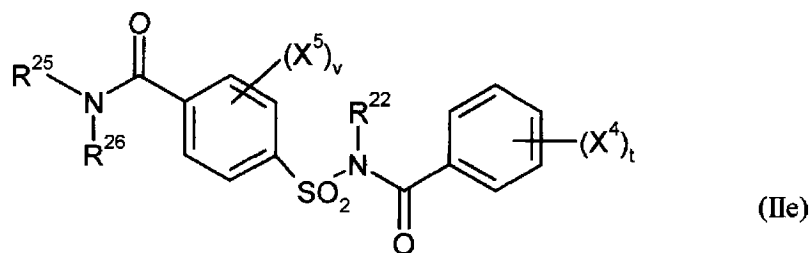
[0330] 通式 (IIId)

[0331]



[0332] 或通式 (IIe)

[0333]



[0334] 其中

[0335] t 代表数值 0、1、2、3、4 或 5，

[0336] v 代表数值 0、1、2、3、4 或 5，

[0337] R^{22} 代表氢或 C_1 - C_4 烷基，

[0338] R^{23} 代表氢或 C_1 - C_4 烷基，

[0339] R^{24} 代表氢，各自任选被氰基、卤素或 C_1 - C_4 烷氧基取代的 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 烷基氨基或二 (C_1 - C_4 烷基) 氨基，或者各自任选被氰基、卤素或 C_1 - C_4 烷基取代的 C_3 - C_6 环烷基、 C_3 - C_6 环烷基氧基、 C_3 - C_6 环烷基硫基或 C_3 - C_6 环烷基氨基，

[0340] R^{25} 代表氢，任选被氰基、羟基、卤素或 C_1 - C_4 烷氧基取代的 C_1 - C_6 烷基，各自任选被氰基或卤素取代的 C_3 - C_6 烯基或 C_3 - C_6 炔基，或任选被氰基、卤素或 C_1 - C_4 烷基取代的 C_3 - C_6 环烷基，

[0341] R^{26} 代表氢，任选被氰基、羟基、卤素或 C_1 - C_4 烷氧基取代的 C_1 - C_6 烷基，各自任选被氰基或卤素取代的 C_3 - C_6 烯基或 C_3 - C_6 炔基，任选被氰基、卤素或 C_1 - C_4 烷基取代的 C_3 - C_6 环烷基，或者任选被硝基、氰基、卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基取代的苯基，或者与 R^{25} 一起代表各自任选被 C_1 - C_4 烷基取代的 C_2 - C_6 烷二基或 C_2 - C_5 氧杂烷二基，

[0342] X^4 代表硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、甲酰基、氨基磺酰基、羟基、氨基、卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基，并且

[0343] X^5 代表硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、甲酰基、氨基磺酰基、羟基、氨基、卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基。

[0344] 式 (I) 提供了本发明化合物的一般定义。对上下文给出的式中所列基团的优选的取代基或范围说明如下：

[0345] J 优选代表 C_3 - C_8 环烷基，所述 C_3 - C_8 环烷基可任选被氧间断，并且可任选被卤素、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷基取代，或任选被由 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、卤素、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基所取代的苯基或 C_3 - C_6 环烷基取代，

[0346] X 优选代表氢、卤素、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_6 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基，

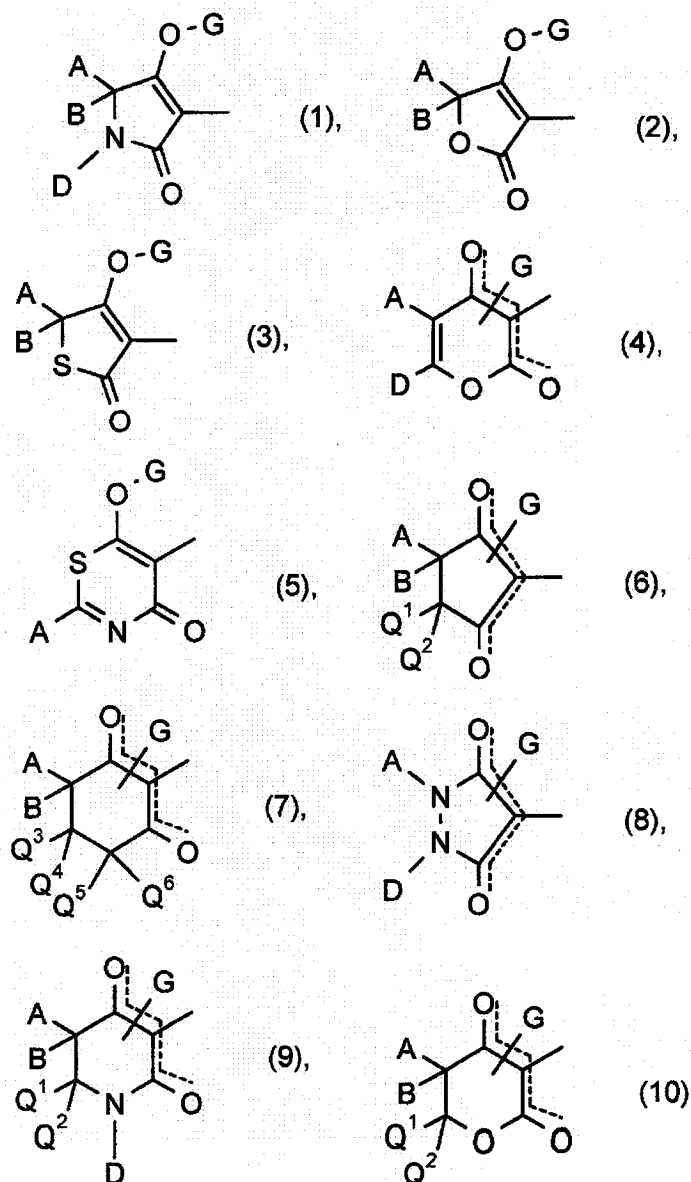
[0347] Y 优选代表氢、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、卤素、 C_1 - C_6 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基，

[0348] m 优选代表数值 1、2 或 3，

[0349] 条件为至少一个基团 J、X 或 Y 位于苯基基团的 2 位并且不为氢，

[0350] CKE 优选代表以下基团之一

[0351]



[0352] A 优选代表氢,或各自任选被卤素取代的 C_1 - C_{12} 烷基、 C_3 - C_8 烯基、 C_1 - C_{10} 烷氧基、 C_1 - C_8 烷基、 C_1 - C_{10} 烷硫基、 C_1 - C_6 烷基,任选被卤素、 C_1 - C_6 烷基或 C_1 - C_6 烷氧基取代的 C_3 - C_8 环烷基,该环烷基中任选地一个或两个不直接相邻的环元素被氧和/或硫替代,或者代表各自任选被卤素、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、氰基或硝基取代的苯基、萘基、具有 5 或 6 个环原子的杂芳基(例如呋喃基、吡啶基、咪唑基、三唑基、吡唑基、噻吩基、噻唑基或噻吩基)、苯基、 C_1 - C_6 烷基或萘基、 C_1 - C_6 烷基,

[0353] B 优选代表氢、 C_1 - C_{12} - 烷基或 C_1 - C_8 烷氧基、 C_1 - C_6 烷基,或

[0354] A、B 与它们所连接的碳原子一起优选代表饱和的 C_3 - C_{10} 环烷基或不饱和的 C_5 - C_{10} 环烷基,所述环烷基中任选地一个环元素被氧或硫替代并且其任选被 C_1 - C_8 烷基、 C_3 - C_{10} 环烷基、 C_1 - C_8 卤代烷基、 C_1 - C_8 烷氧基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_8 烷硫基、卤素或苯基单取代或双取代,或

[0355] A、B 与它们所连接的碳原子一起优选代表被任选含有一或两个不直接相邻的氧和/或硫原子并且任选地由 C_1 - C_4 烷基取代的烷撑二基(alkylenediyl)基团或烷撑二氧基

(alkylenedixyl) 基团或烷撑二硫基 (alkylenedithiyl) 基团取代的 C_3-C_6 环烷基, 所述取代基团与它所连接的碳原子一起形成另一五元至八元环, 或

[0356] A、B 与它们所连接的碳原子一起优选代表 C_3-C_8 环烷基或 C_5-C_8 环烯基, 其中两个取代基与它们所连接的碳原子一起代表各自任选被 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基或卤素取代并且其中任选地一个亚甲基被氧或硫替代的 C_2-C_6 烷二基、 C_2-C_6 烯二基或 C_4-C_6 烷二烯二基,

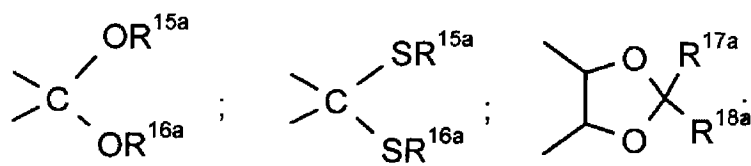
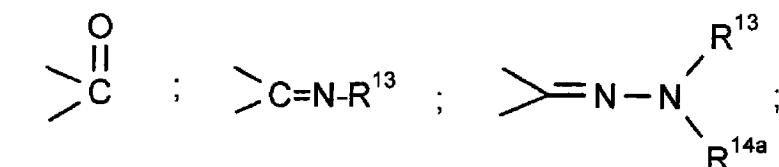
[0357] D 优选代表氢, 各自任选被卤素取代的 C_1-C_{12} 烷基、 C_3-C_8 烯基、 C_3-C_8 炔基、 C_1-C_{10} 烷氧基- C_2-C_8 烷基, 任选被卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 卤代烷基取代并且其中任选地一个环元素被氧或硫替代的 C_3-C_8 环烷基, 或各自任选被卤素、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基、氰基或硝基取代的苯基、具有 5 或 6 个环原子的杂芳基 (例如呋喃基、咪唑基、吡啶基、噻唑基、吡唑基、嘧啶基、吡咯基、噻吩基或三唑基)、苯基- C_1-C_6 烷基或具有 5 或 6 个环原子的杂芳基- C_1-C_6 烷基 (例如呋喃基、咪唑基、吡啶基、噻唑基、吡唑基、嘧啶基、吡咯基、噻吩基或三唑基), 或

[0358] A 和 D 一起优选代表各自任选被取代的 C_3-C_6 烷二基或 C_3-C_6 烯二基, 其中任选地一个亚甲基被羰基、氧或硫替代,

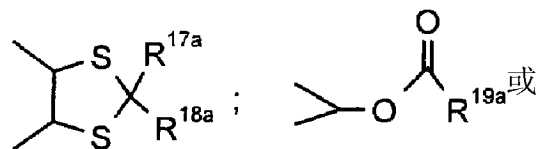
[0359] 可能的取代基各自为:

[0360] 卤素、羟基、巯基或各自任选被卤素取代的 C_1-C_{10} 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_3-C_7 环烷基、苯基或苄氧基; 或者另一个 C_3-C_6 烷二基基团、 C_3-C_6 烯二基基团或丁二烯基基团, 所述基团任选被 C_1-C_6 烷基取代或者所述基团中任选地两个相邻的取代基与它所连接的碳原子一起形成另一具有 5 或 6 个环原子的饱和或不饱和的环 (在式 (I-1) 化合物的情况下, 例如, 其中的 A 和 D 与它们所连接的原子一起代表下面进一步提到的基团 AD-1 至 AD-10), 该环可含有氧或硫或者任选含有以下基团之一

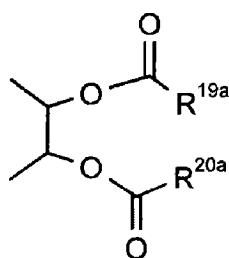
[0361]



[0362]



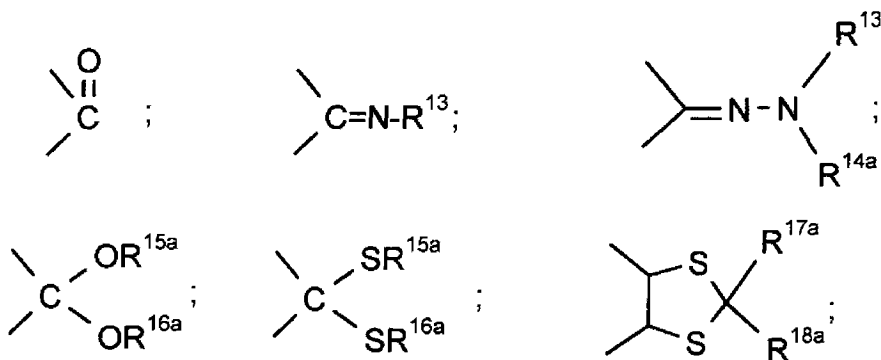
[0363]



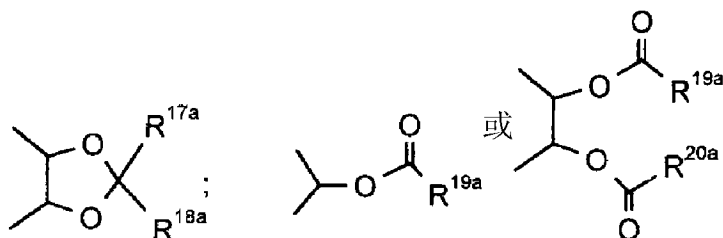
[0364] 或者

[0365] A 和 Q¹ 一起优选代表 C₃-C₆ 烷二基或 C₄-C₆ 烯二基, 其各自任选被选自以下的相同或不同的取代基单取代或双取代: 卤素、羟基, 各自任选被相同或不同的卤素取代基单取代至三取代的 C₁-C₁₀ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₃-C₇ 环烷基, 及各自任选被选自卤素、C₁-C₆ 烷基和 C₁-C₆ 烷氧基的相同或不同的取代基单取代至三取代的苄氧基或苯基, 所述 C₃-C₆ 烷二基或 C₄-C₆ 烯二基还任选含有以下基团之一

[0366]



[0367]



[0368] 或者被 C₁-C₂ 烷二基基团或被氧原子桥接, 或

[0369] D 和 Q¹ 一起优选代表各自任选被相同或不同的 C₁-C₄ 烷基或 C₁-C₄ 烷氧基单取代或双取代并且任选被氧原子间断的 C₃-C₆ 烷二基, 或

[0370] Q¹ 优选代表氢、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基 -C₁-C₂ 烷基, 任选被氟、氯、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₂ 卤代烷基或 C₁-C₄ 烷氧基取代并且其中任选地一个亚甲基基团被氧或硫替代的 C₃-C₈ 环烷基, 或代表任选被卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₂ 卤代烷基、C₁-C₂ 卤代烷氧基、氰基或硝基取代的苯基, 或

[0371] Q²、Q⁴、Q⁵ 和 Q⁶ 相互独立地优选代表氢或 C₁-C₄ 烷基,

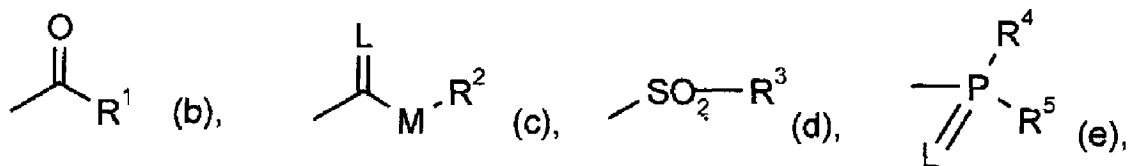
[0372] Q³ 优选代表氢、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基 -C₁-C₂ 烷基、C₁-C₆ 烷硫基 -C₁-C₂ 烷基, 任选被 C₁-C₄ 烷基或 C₁-C₄ 烷氧基取代并且其中任选地一个亚甲基基团被氧或硫替代的 C₃-C₈ 环烷基, 或代表任选被卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₂ 卤代烷基、C₁-C₂ 卤代烷氧基、氰基或硝基取代的苯基,

[0373] Q¹ 和 Q² 与它们所连接的碳原子一起优选代表任选被 C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基或 C₁-C₂ 卤代烷基取代并且其中任选地一个环元素被氧或硫替代的 C₃-C₇ 环烷基, 或

[0374] Q³ 和 Q⁴ 与它们所连接的碳原子一起优选代表任选被 C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基或 C₁-C₂ 卤代烷基取代并且其中任选地一个环元素被氧或硫替代的 C₃-C₇ 环,

[0375] G 优选代表氢 (a) 或代表以下基团之一

[0376]



[0377] E(f) 或 $\begin{array}{c} \text{R}^6 \\ \diagup \\ \text{N} \\ \diagdown \\ \text{R}^7 \end{array}$ 特别是 (a)、(b)、(c) 或 (g),
 L

[0378] 其中

[0379] E 代表一种金属离子等价物或一种铵离子,

[0380] L 代表氧或硫, 并且

[0381] M 代表氧或硫,

[0382] R^1 优选代表各自任选被卤素取代的 $\text{C}_1\text{-C}_{20}$ 烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_{20}$ 烯基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷硫基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷基、多 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷基, 或任选被卤素、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基或 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷氧基取代并且其中任选地一个或多个 (优选不多于两个) 不直接相邻的环元素被氧和 / 或硫替代的 $\text{C}_3\text{-C}_8$ 环烷基,

[0383] 优选代表任选被卤素、氰基、硝基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 卤代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 卤代烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷硫基或 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基磺酰基取代的苯基,

[0384] 优选代表任选被卤素、硝基、氰基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 卤代烷基或 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 卤代烷氧基取代的苯基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基,

[0385] 优选代表任选被卤素或 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基取代的 5 元或 6 元杂芳基 (例如吡唑基、噻唑基、吡啶基、嘧啶基、呋喃基或噻吩基),

[0386] 优选代表任选被卤素或 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基取代的苯氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基, 或

[0387] 优选代表任选被卤素、氨基或 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基取代的 5 或 6 元杂芳基氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基 (例如吡啶基氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、嘧啶基氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基或噻唑基氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基),

[0388] R^2 优选代表各自任选被卤素取代的 $\text{C}_1\text{-C}_{20}$ 烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_{20}$ 烯基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷氧基、 $\text{C}_2\text{-C}_8$ 烷基、多 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷氧基、 $\text{C}_2\text{-C}_8$ 烷基,

[0389] 优选代表任选被卤素、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基或 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷氧基取代的 $\text{C}_3\text{-C}_8$ 环烷基, 或

[0390] 优选代表各自任选被卤素、氰基、硝基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 卤代烷基或 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 卤代烷氧基取代的苯基或苄基,

[0391] R^3 优选代表任选被卤素取代的 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷基, 或代表各自任选被卤素、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷氧基、氰基或硝基取代的苯基或苄基,

[0392] R^4 和 R^5 相互独立地优选代表各自任选被卤素取代的 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷基氨基、二 ($\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷基) 氨基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷硫基、 $\text{C}_2\text{-C}_8$ 烯基硫基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 环烷基硫基, 或代表各自任选被卤素、硝基、氰基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷硫基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷硫基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基或 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 卤代烷基取代的苯基、苯氧基或苯硫基,

[0393] R^6 和 R^7 相互独立地优选代表氢, 代表各自任选被卤素取代的 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_8$ 环烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷氧基、 $\text{C}_3\text{-C}_8$ 烯基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷基, 代表任选被卤素、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 卤代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷基或 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷氧基取代的苯基, 任选被卤素、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 卤代烷基或 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷氧基取代的苄基, 或一起代表任选被 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基取代并且其中任选地一个碳原子被氧或硫替

代的 C₃-C₆ 亚烷基基团,

[0394] R¹³ 优选代表氢, 优选代表各自任选被卤素取代的 C₁-C₈ 烷基或 C₁-C₈ 烷氧基, 代表任选被卤素、C₁-C₄ 烷基或 C₁-C₄ 烷氧基取代并且其中任选地一个亚甲基基团被氧或硫替代的 C₃-C₈ 环烷基, 或代表各自任选被卤素、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、硝基或氰基取代的苯基、苯基 -C₁-C₄ 烷基或苯基 -C₁-C₄ 烷氧基,

[0395] R^{14a} 优选代表氢或 C₁-C₈ 烷基, 或者

[0396] R¹³ 和 R^{14a} 一起优选代表 C₄-C₆ 烷二基,

[0397] R^{15a} 和 R^{16a} 可以相同或不同并且优选代表 C₁-C₆ 烷基, 或

[0398] R^{15a} 和 R^{16a} 一起优选代表任选被 C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基 或被任选由卤素、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、硝基或氰基取代的苯基取代的 C₂-C₄ 烷二基基团,

[0399] R^{17a} 和 R^{18a} 相互独立地优选代表氢, 代表任选被卤素取代的 C₁-C₈ 烷基, 或代表任选被卤素、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、硝基或氰基取代的苯基, 或

[0400] R^{17a} 和 R^{18a} 与它们所连接的碳原子一起优选代表羰基, 或代表任选被卤素、C₁-C₄ 烷基或 C₁-C₄ 烷氧基取代并且基中任选地一个亚甲基基团被氧或硫替代的 C₅-C₇ 环烷基,

[0401] R^{19a} 和 R^{20a} 相互独立地优选代表 C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 烯基、C₁-C₁₀ 烷氧基、C₁-C₁₀ 烷基氨基、C₃-C₁₀ 烯基氨基、二 (C₁-C₁₀ 烷基) 氨基或二 (C₃-C₁₀ 烯基) 氨基。

[0402] 在作为优选提及的基团定义中, 卤素代表氟、氯、溴和碘, 特别是氟、氯和溴。

[0403] J 特别优选代表任选被一个氧原子间断并且任选被氟、氯、C₁-C₄ 烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₁-C₄ 烷氧基或 C₁-C₂ 卤代烷基单取代或双取代的 C₃-C₆ 环烷基,

[0404] X 特别优选代表氢、氟、氯、溴、碘、C₁-C₄ 烷基、三氟甲基、C₁-C₄ 烷氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基,

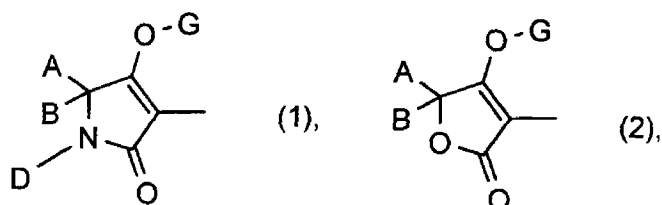
[0405] Y 特别优选代表氢、氟、氯、溴、碘、C₁-C₄ 烷基、三氟甲基、C₁-C₄ 烷氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基,

[0406] m 特别优选代表数值 1 或 2

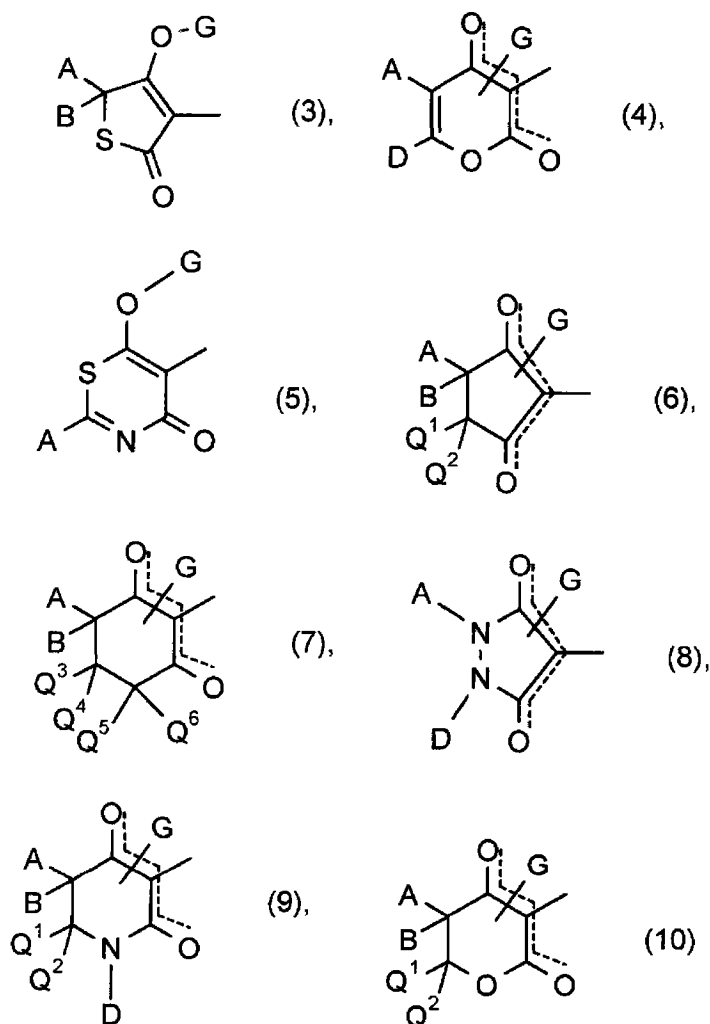
[0407] 条件为至少一个基团 J、X 或 Y 位于苯基基团的 2 位上并且不为氢,

[0408] CKE 特别优选代表以下基团之一

[0409]



[0410]



[0411] A 特别优选代表氢,代表各自任选被氟或氯单取代至三取代的 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_2 烷基,代表任选被 C_1-C_2 烷基或 C_1-C_2 烷氧基单取代或双取代的 C_3-C_6 环烷基,或者(式(I-3)、(I-4)、(I-6)和(I-7)化合物的情况除外)代表各自任选被氟、氯、溴、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_2 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_2 卤代烷氧基、氰基或硝基单取代或双取代的苯基或苄基,

[0412] B 特别优选代表氢、 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_2 烷氧基、 C_1-C_2 烷基,或

[0413] A、B 与它们所连接的碳原子特别优选代表其中任选地一个环元素被氧或硫替代并且其任选被 C_1-C_6 烷基、三氟甲基、 C_1-C_6 烷氧基或 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 烷氧基单取代或双取代的饱和的或不饱和的 C_5-C_7 环烷基,条件为此情况下 Q^3 特别优选代表氢或甲基,或

[0414] A、B 与它们所连接的碳原子特别优选代表被任选含有一个或两个不直接相邻的氧或硫原子并且任选被甲基或乙基取代的烷撑二基、基团或烷撑二氧基基团或烷撑二硫基基团取代的 C_5-C_6 环烷基,所述取代基团与其所连接的碳原子一起形成另一个五元或六元环,条件为此情况下 Q^3 特别优选代表氢或甲基,或

[0415] A、B 与它们所连接的碳原子特别优选代表 C_3-C_6 环烷基或 C_5-C_6 环烯基,其中两个取代基与其所连接的碳原子一起代表各自任选被 C_1-C_2 烷基或 C_1-C_2 烷氧基取代的 C_2-C_4 烷二基、 C_2-C_4 烯二基或丁二烯二基,条件为此情况下 Q^3 特别优选代表氢或甲基,

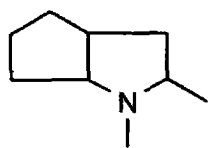
[0416] D 代表氢,代表各自任选被氟单取代至三取代的 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 烯基、 C_1-C_4 烷氧

基 $-C_2-C_3$ 烷基, 代表任选被 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_2 卤代烷基单取代或双取代并且其中任选地一个亚甲基基团被氧替代的 C_3-C_6 环烷基, 或者 (式 (I-1) 化合物的情况除外) 代表各自任选被氟、氯、溴、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 卤代烷氧基单取代或双取代的苯基或吡啶基, 或者

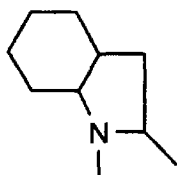
[0417] A 和 D 一起特别优选代表任选被单取代或双取代并且其中一个亚甲基基团可被羰基 (式 (I-1) 化合物的情况除外)、氧或硫替代的 C_3-C_5 烷二基, 可行的取代基为 C_1-C_2 烷基或 C_1-C_2 烷氧基, 或

[0418] A 和 D (式 (I-1) 化合物的情况下) 与它们所连接的原子一起代表基团 AD-1 至 AD-10 之一:

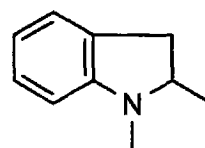
[0419]



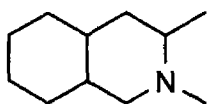
AD-1



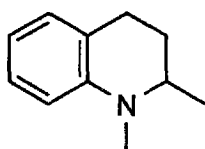
AD-2



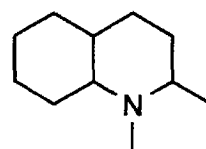
AD-3



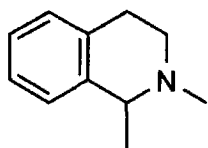
AD-4



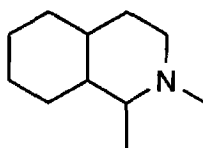
AD-5



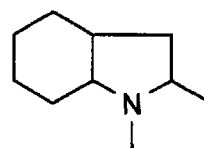
AD-6



AD-7

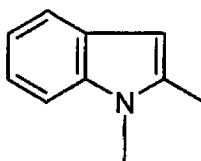


AD-8



AD-9

[0420]



AD-10

[0421] 或者

[0422] A 和 Q^1 一起特别优选代表各自任选被选自 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的相同或不同的取代基单取代或双取代的 C_3-C_4 烷二基, 或者

[0423] D 和 Q^1 一起特别优选代表任选被一个氧原子间断的 C_3-C_4 烷二基, 或

[0424] Q^1 特别优选代表氢、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基 $-C_1-C_2$ 烷基, 或任选被甲基或甲氧基取代并且其中任选地一个亚甲基基团被氧替代的 C_3-C_6 环烷基,

[0425] Q^2 特别优选代表氢、甲基或乙基,

[0426] Q^4 、 Q^5 和 Q^6 相互独立地特别优选代表氢或 C_1-C_3 烷基,

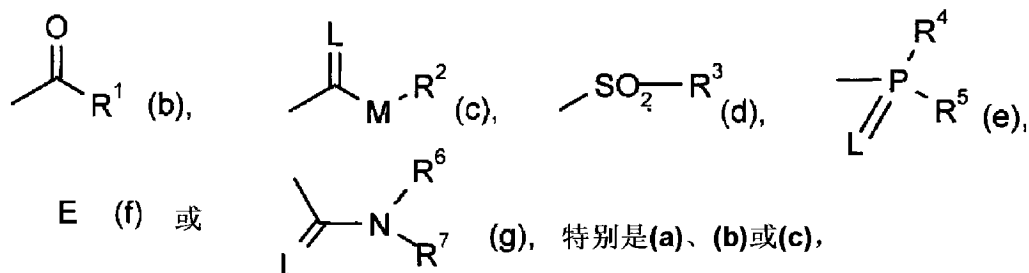
[0427] Q^3 特别优选代表氢、 C_1 - C_4 烷基, 或任选被甲基或甲氧基单取代或双取代的 C_3 - C_6 环烷基,

[0428] Q^1 和 Q^2 与它们所连接的碳一起特别优选代表任选被 C_1 - C_4 烷基或 C_1 - C_4 烷氧基取代并且其中任选地一个环元素被氧替代的饱和的 C_5 - C_6 环烷基, 或

[0429] Q^3 和 Q^4 与它们所连接的碳一起特别优选代表任选被 C_1 - C_2 烷基或 C_1 - C_2 烷氧基取代并且其中任选地一个环元素被氧或硫替代的饱和的 C_5 - C_6 环, 条件为在此情况下 A 特别优选代表氢或甲基,

[0430] G 特别优选代表氢 (a) 或代表以下基团之一

[0431]



[0432] 其中

[0433] E 代表一种金属离子等价物或一种铵离子,

[0434] L 代表氧或硫

[0435] M 代表氧或硫,

[0436] R^1 特别优选代表各自任选被氟或氯单取代至三取代的 C_1 - C_8 烷基、 C_2 - C_{18} 烯基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_4 - 烷硫基- C_1 - C_2 烷基, 或任选被氟、氯、 C_1 - C_2 烷基或 C_1 - C_2 烷氧基单取代或双取代并且其中任选地一个或两个不直接相邻的环元素被氧替代的 C_3 - C_6 环烷基,

[0437] 特别优选代表任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_2 卤代烷基或 C_1 - C_2 卤代烷氧基单取代或双取代的苯基,

[0438] R^2 特别优选代表各自任选被氟单取代至三取代的 C_1 - C_8 烷基、 C_2 - C_8 烯基或 C_1 - C_4 烷氧基- C_2 - C_4 烷基,

[0439] 特别优选代表任选被 C_1 - C_2 烷基或 C_1 - C_2 烷氧基单取代的 C_3 - C_6 环烷基, 或

[0440] 特别优选代表各自任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_3 烷氧基、三氟甲基或三氟甲氧基单取代或双取代的苯基或苄基,

[0441] R^3 特别优选代表任选被氟单取代至三取代的 C_1 - C_6 烷基, 或代表任选被氟、氯、溴、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或硝基单取代的苯基,

[0442] R^4 特别优选代表 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷基氨基、二 (C_1 - C_6 烷基) 氨基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_3 - C_4 烯基硫基、 C_3 - C_6 环烷基硫基, 或代表各自任选被氟、氯、溴、硝基、氰基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 卤代烷氧基、 C_1 - C_3 烷硫基、 C_1 - C_3 卤代烷硫基、 C_1 - C_3 烷基或三氟甲基单取代的苯基、苯氧基或苯硫基,

[0443] R^5 特别优选代表 C_1 - C_6 烷氧基或 C_1 - C_6 烷硫基,

[0444] R^6 特别优选代表氢、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_3 - C_6 烯基、 C_1 - C_6 烷氧基- C_1 - C_4 烷基, 代表任选被氟、氯、溴、三氟甲基、 C_1 - C_4 烷基或 C_1 - C_4 烷氧基单取代的苯基, 代

表任选被氟、氯、溴、 C_1-C_4 烷基、三氟甲基或 C_1-C_4 烷氧基单取代的苄基，

[0445] R^7 特别优选代表 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 烯基或 C_1-C_6 烷氧基- C_1-C_4 烷基，

[0446] R^6 和 R^7 一起特别优选代表任选被甲基或乙基取代并且其中任选地一个亚甲基基团被氧或硫替代的 C_4-C_5 亚烷基基团。

[0447] 在作为特别优选所提及的基团定义中，卤素代表氟、氯和溴，特别是氟和氯。

[0448] J 极特别优选代表环丙基、二环丙基、环丁基、环戊基、环己基、氧杂环丁基(oxetanyl)、四氢糠基(tetrahydrofurfuryl)、四氢吡喃基，

[0449] X 极特别优选代表氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、丙基、甲氧基或乙氧基，

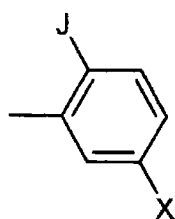
[0450] Y 极特别优选代表氢、氯、溴、甲基、乙基、丙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基或三氟甲氧基，

[0451] m 极特别优选代表数值 1 或 2，

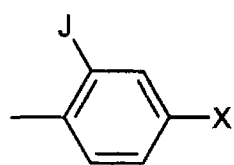
[0452] 条件为至少一个基团 J、X 或 Y 位于苯基基团的 2 位并且不为氢。

[0453] 本说明书中，具有其极特别优选含义的基团 J、X 和 Y 极特别优选按以下苯基取代型式排列

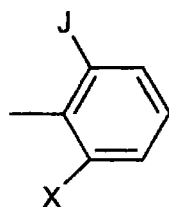
[0454]



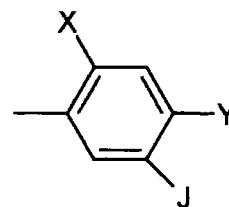
(A)



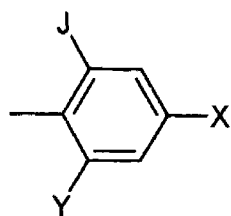
(B)



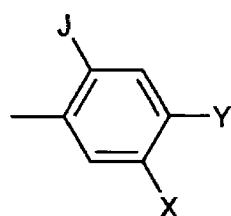
(C)



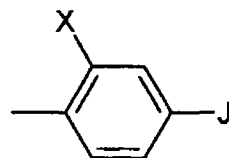
(D)



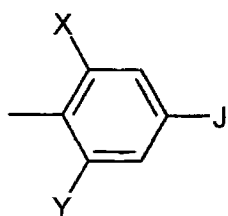
(E) $Y \neq H$



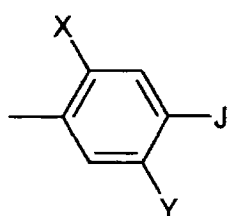
(F) $Y \neq H$



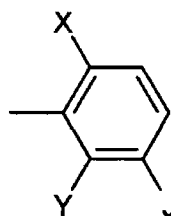
(G)



(H) $Y \neq H$

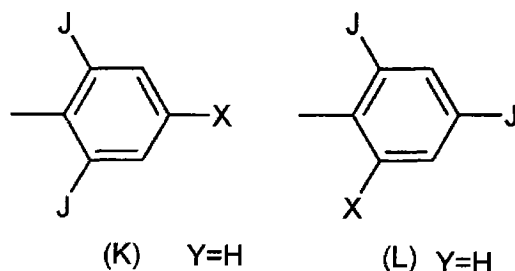


(I) $Y \neq H$



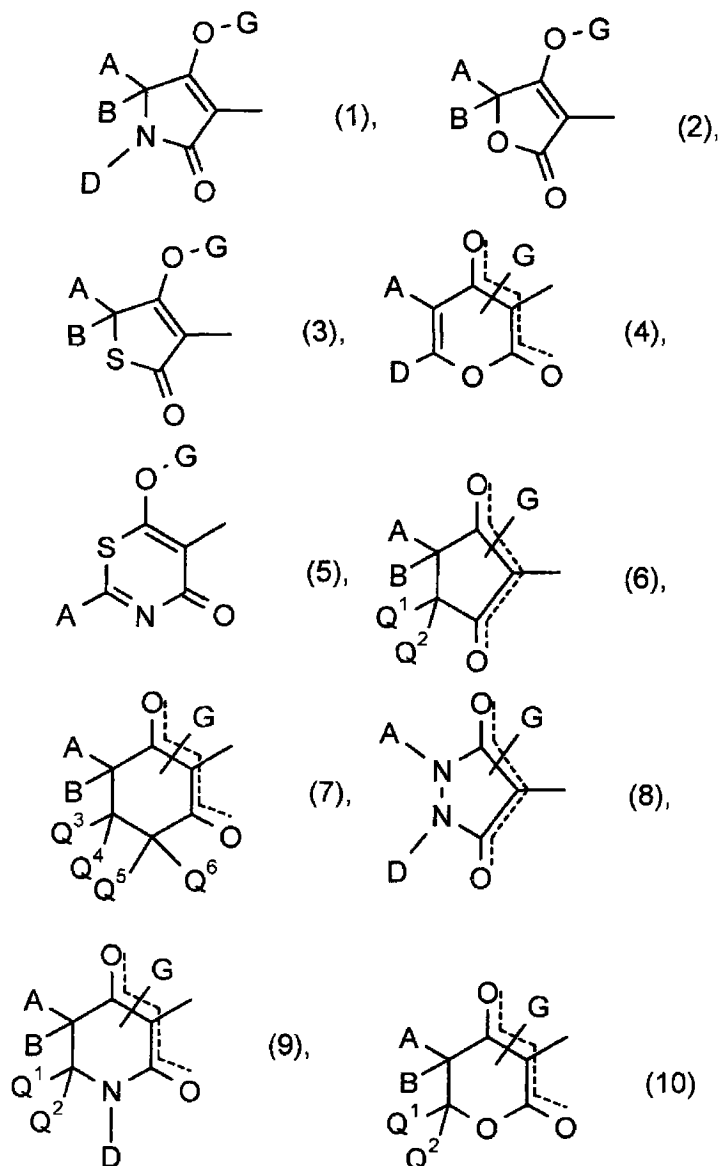
(J) $Y \neq H$

[0455]



[0456] 其中只有在苯基取代型式 (B)、(K) 和 (L) 中, X 也可以代表氢, CKE 极特别优选代表以下基团之一

[0457]



[0458] A 极特别优选代表氢, 代表各自任选被氟单取代至三取代的 C_1 - C_4 烷基或 C_1 - C_2 烷氧基 - C_1 - C_2 烷基, 代表环丙基、环戊基或环己基, 并且仅在式 (I-5) 化合物的情况下代表任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或硝基单取代或双取代的苯基,

[0459] B 极特别优选代表氢、甲基或乙基, 或

[0460] A、B 与它们所连接的碳原子极特别优选代表其中任选地一个环元素被氧或硫替代

并且其任选被甲基、乙基、丙基、异丙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、丙氧基、甲氧基乙氧基、丁氧基、甲氧基甲基或乙氧基乙氧基单取代的饱和的 C_5-C_6 环烷基, 条件为此情况下 Q^3 极特别优选代表氢, 或

[0461] A、B 与它们所连接的碳原子极特别优选代表任选被含有两个不直接相邻的氧原子的烷撑二氧基基团取代的 C_6 环烷基, 条件为此情况下 Q^3 极特别优选代表氢, 或

[0462] A、B 与它们所连接的碳原子极特别优选代表其中两个取代基与它们所连接的碳原子一起代表 C_2-C_4 烷二基或 C_2-C_4 烯二基或丁二烯二基的 C_5-C_6 环烷基或 C_5-C_6 环烯基, 条件为此情况下 Q^3 极特别优选代表氢,

[0463] D 极特别优选代表氢, 代表各自任选被氟单取代至三取代的 C_1-C_4 烷基、 C_3-C_4 烯基、 C_1-C_4 烷氧基- C_2-C_3 烷基, 代表环丙基、环戊基或环己基, 或 (式 (I-1) 化合物的情况除外) 代表各自任选被氟、氯、甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基或三氟甲基单取代的苯基或吡啶基,

[0464] 或者

[0465] A 和 D 一起极特别优选代表任选被甲基或甲氧基单取代并且其中任选地一个碳原子被氧或硫替代的 C_3-C_5 烷二基, 或代表基团 AD-1,

[0466] A 和 Q^1 一起极特别优选代表任选被甲基或甲氧基单取代或双取代的 C_3-C_4 烷二基, 或

[0467] D 和 Q^1 一起极特别优选代表 C_3-C_4 烷二基,

[0468] Q^1 极特别优选代表氢、甲基、乙基、丙基、异丙基、环丙基、环戊基或环己基,

[0469] Q^2 极特别优选为氢或甲基,

[0470] Q^4 、 Q^5 和 Q^6 相互独立地极特别优选代表氢或甲基,

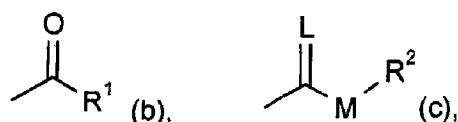
[0471] Q^3 极特别优选代表氢、甲基、乙基或丙基, 或

[0472] Q^1 和 Q^2 与它们所连接的碳一起极特别优选代表任选被甲基、乙基、丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、丙氧基或丁氧基取代并且其中任选地一个环元素被氧替代的饱和的 C_5-C_6 环烷基, 或

[0473] Q^3 和 Q^4 与它们所连接的碳一起极特别优选代表任选被甲基或甲氧基单取代的饱和的 C_5-C_6 环, 条件为此情况下 A 极特别优选代表氢,

[0474] G 极特别优选代表氢 (a) 或代表以下基团之一

[0475]



[0476] $-\text{SO}_2-\text{R}^3$ (d) 或 E (f),

[0477] 其中

[0478] L 代表氧或硫,

[0479] M 代表氧或硫, 并且

[0480] E 代表一种铵离子

[0481] R^1 极特别优选代表各自任选被氯单取代的 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_{17} 烯基、 C_1-C_2 烷氧基- C_1 烷基、 C_1-C_2 烷硫基- C_1 烷基, 或代表各自任选被氟、氯、甲基或甲氧基单取代的环丙基或环

己基,

[0482] 极特别优选代表任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、甲基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基单取代的苯基,

[0483] R^2 极特别优选代表各自任选被氟单取代的 C_1-C_8 烷基、 C_2-C_6 烯基或 C_1-C_4 烷氧基- C_2-C_3 烷基, 或者代表苯基或苄基,

[0484] R^3 极特别优选代表 C_1-C_8 烷基。

[0485] J 最优选代表环丙基,

[0486] X 最优选代表氯、甲基或乙基,

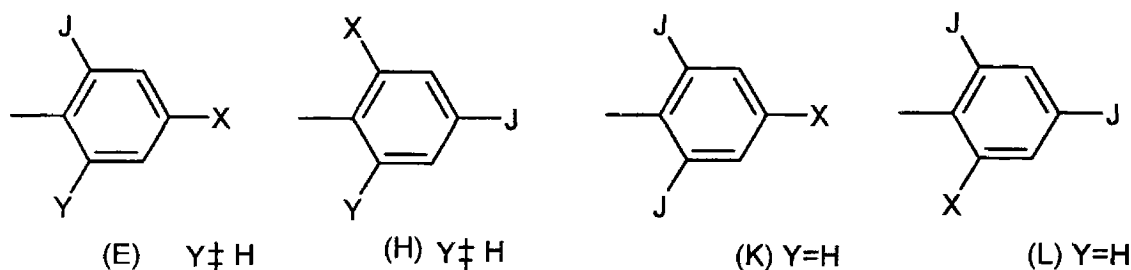
[0487] Y 最优选代表氯、甲基、乙基或氢,

[0488] m 最优选代表数值 1 或 2,

[0489] 条件为至少一个基团 J、X 或 Y 位于苯基基团的 2 位上并且不为氢。

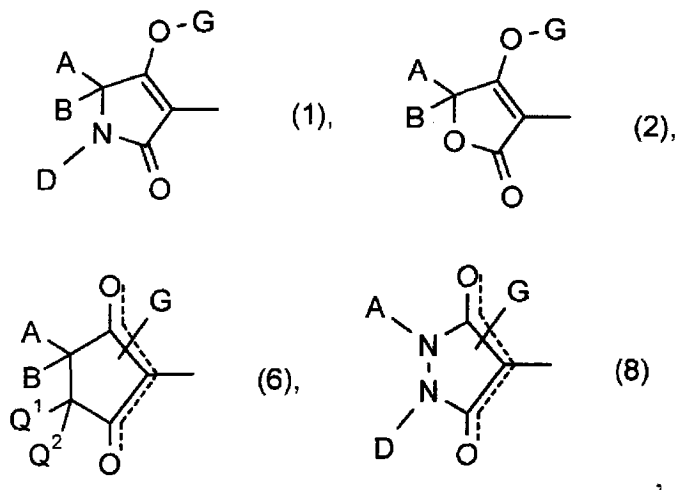
[0490] 本说明书中, 具有最优选含义的基团 J、X 和 Y 尤其优选按以下苯基取代型式排列

[0491]



[0492] CKE 最优选代表以下基团之一

[0493]



[0494] A 最优选代表 C_1-C_4 烷基或环丙基,

[0495] B 最优选代表氢或甲基, 或

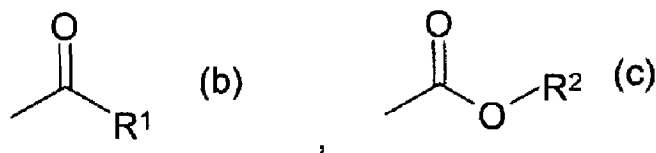
[0496] A、B 与它们所连接的碳原子最优选代表其中任选地一个环元素被氧替代并且其任选被甲氧基、乙氧基、丁氧基或甲氧基甲基单取代的饱和的 C_5-C_6 环烷基,

[0497] A、B 与它们所连接的碳原子最优选代表任选被具有两个不直接相邻的氧原子的 C_2-C_3 烷撑二氧基基团取代的 C_6 环烷基,

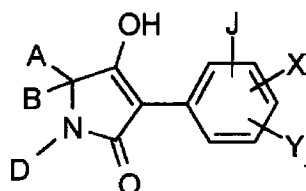
[0498] D 最优选代表氢, 或

[0499] A 和 D 一起最优选代表 C_3-C_5 烷二基,

- [0500] A 和 Q^1 一起最优选代表 C_3 - C_4 烷二基，
 [0501] Q^2 最优选代表氢，
 [0502] G 最优选代表氢 (a) 或代表以下基团之一
 [0503]



- [0504] 或 SO_2-R^3 (d),
 [0505] R^1 最优选代表 C_1 - C_6 烷基, 或代表被氯单取代的苯基,
 [0506] R^2 最优选代表 C_1 - C_8 烷基,
 [0507] R^3 最优选代表 C_1 - C_8 烷基。
 [0508] 上面给出的一般的或优选的基团定义或说明可按需要相互结合, 即包括各自范围和优选范围之间的结合。它们既适用于终产物也相应地适用于前体和中间体。
 [0509] 本发明优选含有以上作为优选给出的 (优选的) 含义的结合的式 (I) 化合物。
 [0510] 本发明特别优选含有以上作为特别优选给出的含义的结合的式 (I) 化合物。
 [0511] 本发明极特别优选含有以上作为极特别优选给出的含义的结合的式 (I) 化合物。
 [0512] 本发明最优选含有以上作为最优选给出的含义的结合的式 (I) 化合物。
 [0513] 饱和的或不饱和的烃基, 例如烷基、烷二基或烯基, 只要可能, 可各自为直链或支链, 包括与杂原子的结合, 例如, 在烷氧基中。
 [0514] 除非另有指明, 任选被取代的基团可为单取代的或多取代的, 其中在多取代的情况下, 取代基可以相同或不同。
 [0515] 除在制备实施例中提及的化合物之外, 可特别提及以下式 (I-1-a) 的化合物:
 [0516]

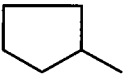
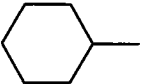


- [0517] 表 1: $J = 2 - \triangle$; $X = H$; $Y = H$ 。
 [0518]

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

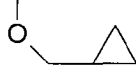
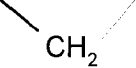
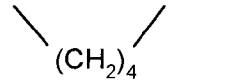
[0519] 表 1(续)：

[0520]

A	B	D
	CH ₃	H
	CH ₃	H
-(CH ₂) ₂ -		H
-(CH ₂) ₄ -		H
-(CH ₂) ₅ -		H
-(CH ₂) ₆ -		H
-(CH ₂) ₇ -		H
-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		H
-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		H
-(CH ₂) ₂ -S-(CH ₂) ₂ -		H
-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₃ -		H
-CH ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₃ -		H
-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		H
-CH ₂ -CHOC ₃ H ₇ -(CH ₂) ₃ -		H

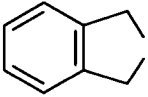
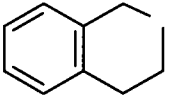
[0521] 表 1(续):

[0522]

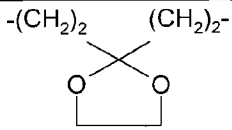
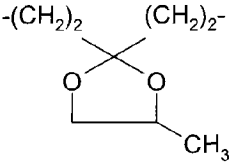
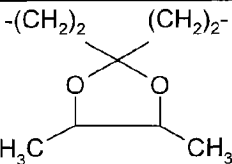
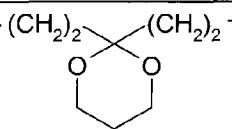
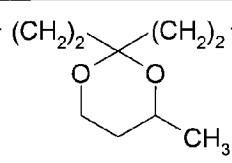
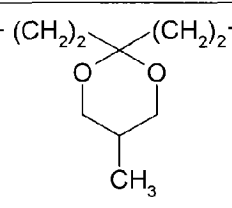
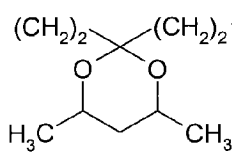
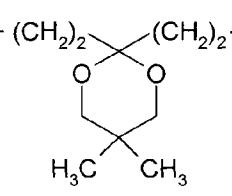
A	B	D
$-\text{CH}_2-\text{CHOC}_4\text{H}_9-(\text{CH}_2)_3-$		H
$-\text{CH}_2-\text{CHO}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_3-(\text{CH}_2)_3-$		H
$-\text{CH}_2-\text{CH}-(\text{CH}_2)_3-$ 		H
$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHCH}_3-(\text{CH}_2)_2-$		H
$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHC}_2\text{H}_5-(\text{CH}_2)_2-$		H
$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHC}_3\text{H}_7-(\text{CH}_2)_2-$		H
$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHi}-\text{C}_3\text{H}_7-(\text{CH}_2)_2-$		H
$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHOCH}_3-(\text{CH}_2)_2-$		H
$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHOC}_2\text{H}_5-(\text{CH}_2)_2-$		H
$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHOC}_3\text{H}_7-(\text{CH}_2)_2-$		H
$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHO}-\text{i}-\text{C}_3\text{H}_7-(\text{CH}_2)_2-$		H
$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(\text{CH}_3)_2-(\text{CH}_2)_2-$		H
$-\text{CH}_2-(\text{CHCH}_3)_2-(\text{CH}_2)_2-$		H
$-\text{CH}_2-\text{CH}-(\text{CH}_2)_2-\text{CH}-$ 		H
$-\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}-\text{CH}_2-$ 		H

[0523] 表 1(续):

[0524]

A	B	D
$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH} \text{---} \text{CH---}(\text{CH}_2)_2\text{---} \\ \quad \quad \quad \diagdown \quad \diagup \\ \quad \quad \quad (\text{CH}_2)_3 \end{array}$		H
		H
		H

[0525]

A	B	D
		H
		H
		H
		H
		H
		H
		H
		H

[0526]

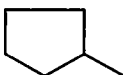
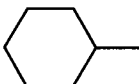
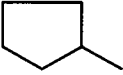
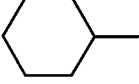
A	B	D
	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{CH}_2-\text{C}-(\text{CH}_2)_3- \\ \\ \text{CH}_2\text{OCH}_3 \end{array}$	H
	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{CH}_2-\text{C}-(\text{CH}_2)_3- \\ \\ (\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3 \end{array}$	H
	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -(\text{CH}_2)_2-\text{C}-(\text{CH}_2)_2-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

A	D	B
---	---	---

[0527]

A	D	B
	$-(\text{CH}_2)_3-$	H
	$-(\text{CH}_2)_4-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-\text{CH}_2-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-\text{CHCH}_3-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{OCH}_3)-\text{CH}_2-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-$	H
	$-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\underset{\text{CH}_2}{\text{CH}}}-\text{CH}-\text{CH}_2-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{S}-(\text{CH}_2)_2-$	H
	$-(\text{CH}_2)_2-\text{S}-\text{CH}_2-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}-$ $\quad \quad \quad \diagdown \quad \diagup$ $\quad \quad \quad (\text{CH}_2)_3$	H
H	CH_3	H
H	C_2H_5	H
H	C_3H_7	H
H	$i\text{-C}_3\text{H}_7$	H
H	$\triangle$	H

[0528]

A	D	B
H		H
H		H
CH ₃	CH ₃	H
CH ₃	C ₂ H ₅	H
CH ₃	C ₃ H ₇	H
CH ₃	i-C ₃ H ₇	H
CH ₃		H
CH ₃		H
CH ₃		H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H

[0529] 表 2 :A、B 和 D 如表 1 中所列

[0530] $J = 2 - \triangleleft$;X = 4-CH₃ ;Y = H

[0531] 表 3 :A、B 和 D 如表 1 中所列

[0532] $J = 2 - \triangleleft$;X = 6-CH₃ ;Y = H。

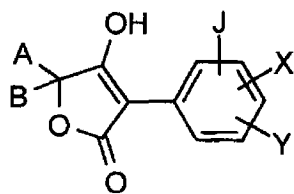
[0533] 表 4 :A、B 和 D 如表 1 中所列

[0534] $J = 2 - \triangleleft$;X = 6-C₂H₅ ;Y = H。

[0535] 表 5 :A、B 和 D 如表 1 中所列

[0536] X = 2-CH₃ ;Y = H ; $J = 5 - \triangleleft$;

- [0537] 表 6 :A、B 和 D 如表 1 中所列
- [0538] $X = 2\text{-CH}_3$; $Y = 4\text{-CH}_3$; $J = 5 - \triangleleft$;
- [0539] 表 7 :A、B 和 D 如表 1 中所列
- [0540] $J = 2 - \triangleleft$; $X = 4\text{-CH}_3$; $Y = 6\text{-CH}_3$ 。
- [0541] 表 8 :A、B 和 D 如表 1 中所列
- [0542] $J = 2 - \triangleleft$; $X = 6\text{-C}_2\text{H}_5$; $Y = 4\text{-CH}_3$ 。
- [0543] 表 9 :A、B 和 D 如表 1 中所列
- [0544] $J = 2 - \triangleleft$; $X = 6\text{-CH}_3$; $Y = 4\text{-Cl}$ 。
- [0545] 表 10 :A、B 和 D 如表 1 中所列
- [0546] $J = 2 - \triangleleft$; $X = 6\text{-C}_2\text{H}_5$; $Y = 4\text{-Cl}$ 。
- [0547] 表 11 :A、B 和 D 如表 1 中所列
- [0548] $J = 2 - \triangleleft$; $X = 6\text{-Cl}$; $Y = 4\text{-CH}_3$ 。
- [0549] 表 12 :A、B 和 D 如表 1 中所列
- [0550] $J = 2 - \triangleleft$; $X = 5\text{-CH}_3$; $Y = 4\text{-CH}_3$ 。
- [0551] 表 13 :A、B 和 D 如表 1 中所列
- [0552] $X = 2\text{-CH}_3$; $J = 4 - \triangleleft$; $Y = \text{H}$ 。
- [0553] 表 14 :A、B 和 D 如表 1 中所列
- [0554] $X = 2\text{-C}_2\text{H}_5$; $J = 4 - \triangleleft$; $Y = \text{H}$ 。
- [0555] 表 15 :A、B 和 D 如表 1 中所列
- [0556] $X = 2\text{-CH}_3$; $J = 4 - \triangleleft$; $Y = 6\text{-CH}_3$ 。
- [0557] 表 16 :A、B 和 D 如表 1 中所列
- [0558] $X = 2\text{-C}_2\text{H}_5$; $J = 4 - \triangleleft$; $Y = 6\text{-CH}_3$ 。
- [0559] 表 17 :A、B 和 D 如表 1 中所列
- [0560] $X = 2\text{-C}_2\text{H}_5$; $J = 4 - \triangleleft$; $Y = 6\text{-C}_2\text{H}_5$ 。
- [0561] 表 18 :A、B 和 D 如表 1 中所列
- [0562] $X = 2\text{-Cl}$; $J = 4 - \triangleleft$; $Y = 6\text{-CH}_3$ 。
- [0563] 表 19 :A、B 和 D 如表 1 中所列
- [0564] $X = 2\text{-Cl}$; $J = 4 - \triangleleft$; $Y = 6\text{-C}_2\text{H}_5$ 。
- [0565] 表 20 :A、B 和 D 如表 1 中所列
- [0566] $X = 2\text{-CH}_3$; $J = 4 - \triangleleft$; $Y = 5\text{-CH}_3$ 。
- [0567] 表 21 :A、B 和 D 如表 1 中所列
- [0568] $X = 2\text{-CH}_3$; $J = 3 - \triangleleft$; $Y = 6\text{-CH}_3$ 。
- [0569] 表 22 :A、B 和 D 如表 1 中所列
- [0570] $J = 2 - \triangleleft$; $X = 5\text{-CH}_3$; $Y = \text{H}$ 。
- [0571] 表 22a :A 和 B 如表 1 中所列
- [0572] $J = 2 - \triangleleft$; $X = 5 - \triangleleft$; $Y = \text{H}$ 。
- [0573]

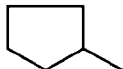
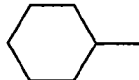


[0574] 表 23 J = 2 -  ; X = H ; Y = H。

[0575]

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

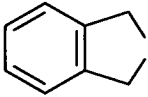
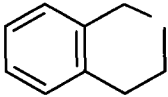
[0576]

A	B
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
	CH ₃
	CH ₃
	CH ₃
-(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₄ -	
-(CH ₂) ₅ -	
-(CH ₂) ₆ -	

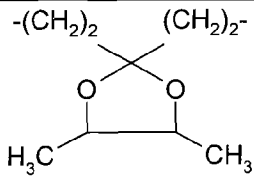
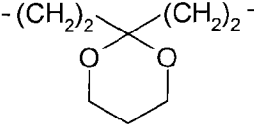
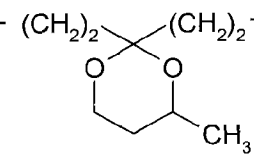
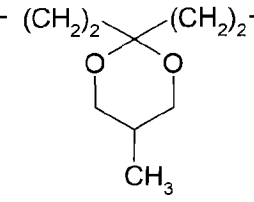
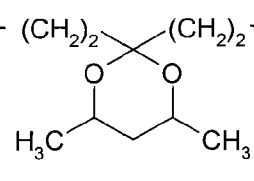
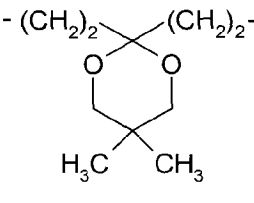
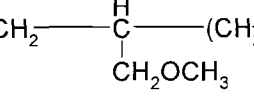
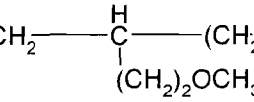
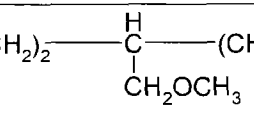
[0577]

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

[0578]

A	B
	$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHOC}_3\text{H}_7-(\text{CH}_2)_2-$
	$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHO}-i-\text{C}_3\text{H}_7-(\text{CH}_2)_2-$
	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(\text{CH}_3)_2-(\text{CH}_2)_2-$
	$-\text{CH}_2-(\text{CHCH}_3)_2-(\text{CH}_2)_2-$
	$ \begin{array}{c} -\text{CH}_2-\text{CH}-(\text{CH}_2)_2-\text{CH}- \\ \quad \quad \quad \diagdown \quad \diagup \\ \quad \quad \quad \text{CH}_2 \end{array} $
	$ \begin{array}{c} -\text{CH}_2-\text{CH} \quad \quad \quad \text{CH}-\text{CH}_2- \\ \quad \quad \quad \diagdown \quad \diagup \\ \quad \quad \quad (\text{CH}_2)_4 \end{array} $
	$ \begin{array}{c} -\text{CH}_2-\text{CH} \quad \quad \quad \text{CH}-(\text{CH}_2)_2- \\ \quad \quad \quad \diagdown \quad \diagup \\ \quad \quad \quad (\text{CH}_2)_3 \end{array} $
	
	
	$ \begin{array}{c} -(\text{CH}_2)_2 \quad \quad (\text{CH}_2)_2- \\ \quad \quad \diagdown \quad \diagup \\ \quad \quad \text{O} \quad \text{O} \\ \quad \quad \diagup \quad \diagdown \\ \quad \quad \text{O} \end{array} $
	$ \begin{array}{c} -(\text{CH}_2)_2 \quad \quad (\text{CH}_2)_2- \\ \quad \quad \diagdown \quad \diagup \\ \quad \quad \text{O} \quad \text{O} \\ \quad \quad \diagup \quad \diagdown \\ \quad \quad \text{O} \quad \text{CH}_3 \end{array} $

[0579]

A	B
	
	
	
	
	
	
	
	
	

[0580]

A	B
	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\text{H}}{\underset{(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3}{\text{C}}}-(\text{CH}_2)_2-$
	$-\text{CH}_2-\overset{\text{H}}{\underset{\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3}{\text{C}}}-(\text{CH}_2)_3-$
	$-\text{CH}_2-\overset{\text{H}}{\underset{(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_2\text{CH}_3}{\text{C}}}-(\text{CH}_2)_3-$
	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\text{H}}{\underset{\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3}{\text{C}}}-(\text{CH}_2)_2-$
	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\text{H}}{\underset{(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_2\text{CH}_3}{\text{C}}}-(\text{CH}_2)_2-$

[0581] 表 24 :A 和 B 如表 23 中所列

[0582] $\text{J} = 2 - \triangleleft$; $\text{X} = 4\text{-CH}_3$; $\text{Y} = \text{H}$

[0583] 表 25 :A 和 B 如表 23 中所列

[0584] $\text{J} = 2 - \triangleleft$; $\text{X} = 6\text{-CH}_3$; $\text{Y} = \text{H}$ 。

[0585] 表 26 :A 和 B 如表 23 中所列

[0586] $\text{J} = 2 - \triangleleft$; $\text{X} = 6\text{-C}_2\text{H}_5$; $\text{Y} = \text{H}$ 。

[0587] 表 27 :A 和 B 如表 23 中所列

[0588] $\text{X} = 2\text{-CH}_3$; $\text{Y} = \text{H}$; $\text{J} = 5 - \triangleleft$ 。

[0589] 表 28 :A 和 B 如表 23 中所列

[0590] $\text{X} = 2\text{-CH}_3$; $\text{Y} = 4\text{-CH}_3$; $\text{J} = 5 - \triangleleft$ 。

[0591] 表 29 :A 和 B 如表 23 中所列

[0592] $\text{J} = 2 - \triangleleft$; $\text{X} = 4\text{-CH}_3$; $\text{Y} = 6\text{-CH}_3$ 。

[0593] 表 30 :A 和 B 如表 23 中所列

[0594] $\text{J} = 2 - \triangleleft$; $\text{X} = 6\text{-C}_2\text{H}_5$; $\text{Y} = 4\text{-CH}_3$ 。

[0595] 表 31 :A 和 B 如表 23 中所列

[0596] $\text{J} = 2 - \triangleleft$; $\text{X} = 6\text{-CH}_3$; $\text{Y} = 4\text{-Cl}$ 。

[0597] 表 32 :A 和 B 如表 23 中所列

[0598] $\text{J} = 2 - \triangleleft$; $\text{X} = 6\text{-C}_2\text{H}_5$; $\text{Y} = 4\text{-Cl}$ 。

[0599] 表 33 :A 和 B 如表 23 中所列

[0600] $\text{J} = 2 - \triangleleft$; $\text{X} = 6\text{-Cl}$; $\text{Y} = 4\text{-CH}_3$ 。

[0601] 表 34 :A 和 B 如表 23 中所列

[0602] $J = 2 - \triangle$; $X = 5\text{-CH}_3$; $Y = 4\text{-CH}_3$ 。

[0603] 表 35 :A 和 B 如表 23 中所列

[0604] $X = 2\text{-CH}_3$; $J = 4 - \triangle$; $Y = \text{H}$ 。

[0605] 表 36 :A 和 B 如表 23 中所列

[0606] $X = 2\text{-C}_2\text{H}_5$; $J = 4 - \triangle$; $Y = \text{H}$ 。

[0607] 表 37 :A 和 B 如表 23 中所列

[0608] $X = 2\text{-CH}_3$; $J = 4 - \triangle$; $Y = 6\text{-CH}_3$ 。

[0609] 表 38 :A 和 B 如表 23 中所列

[0610] $X = 2\text{-C}_2\text{H}_5$; $J = 4 - \triangle$; $Y = 6\text{-CH}_3$ 。

[0611] 表 39 :A 和 B 如表 23 中所列

[0612] $X = 2\text{-C}_2\text{H}_5$; $J = 4 - \triangle$; $Y = 6\text{-C}_2\text{H}_5$ 。

[0613] 表 40 :A 和 B 如表 23 中所列

[0614] $X = 2\text{-Cl}$; $J = 4 - \triangle$; $Y = 6\text{-CH}_3$ 。

[0615] 表 41 :A 和 B 如表 23 中所列

[0616] $X = 2\text{-Cl}$; $J = 4 - \triangle$; $Y = 6\text{-C}_2\text{H}_5$ 。

[0617] 表 42 :A 和 B 如表 23 中所列

[0618] $X = 2\text{-CH}_3$; $J = 4 - \triangle$; $Y = 5\text{-CH}_3$ 。

[0619] 表 43 :A 和 B 如表 23 中所列

[0620] $X = 2\text{-CH}_3$; $J = 3 - \triangle$; $Y = 6\text{-CH}_3$ 。

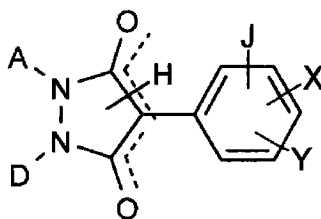
[0621] 表 44 :A 和 B 如表 23 中所列

[0622] $J = 2 - \triangle$; $X = 5\text{-CH}_3$; $Y = \text{H}$ 。

[0623] 表 45 :A 和 B 如表 23 中所列

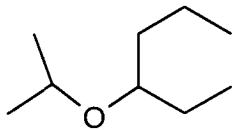
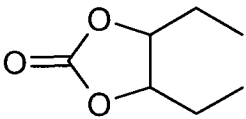
[0624] $J = 2 - \triangle$; $X = 5 - \triangle$; $Y = \text{H}$ 。

[0625]

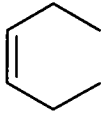
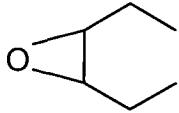
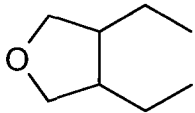
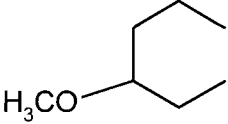
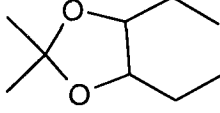
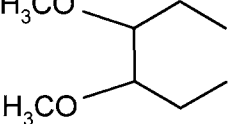
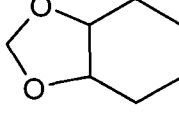
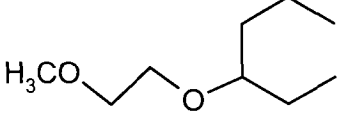


[0626] 表 46 : $J = 2 - \triangle$; $X = \text{H}$; $Y = \text{H}$ 。

[0627]

A	D
CH_3	CH_3
CH_3	$-(\text{CH}_2)_2\text{OH}$
CH_3	$-(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$
CH_3	$-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$
$-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{CH}_3$	$-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{CH}_3$
$-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$	$-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$
$-(\text{CH}_2)_3-$	
$-(\text{CH}_2)_4-$	
$-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(\text{CH}_2)_2-$	
	
	

[0628]

A	D
	
	
	
	
	
	
	
	

[0629] 表 47 :A 和 D 如表 46 中所列

[0630] $J = 2$ -  ; $X = 4\text{-CH}_3$; $Y = \text{H}$

[0631] 表 48 :A 和 D 如表 46 中所列

[0632] $J = 2$ -  ; $X = 6\text{-CH}_3$; $Y = \text{H}$ 。

[0633] 表 49 :A 和 D 如表 46 中所列

[0634] $J = 2$ -  ; $X = 6\text{-C}_2\text{H}_5$; $Y = \text{H}$ 。

[0635] 表 50 :A 和 D 如表 46 中所列

[0636] $X = 2\text{-CH}_3$; $Y = \text{H}$; $J = 5$ -  ;

[0637] 表 51 :A 和 D 如表 46 中所列

[0638] $X = 2\text{-CH}_3$; $Y = 4\text{-CH}_3$; $J = 5 - \triangleleft$;

[0639] 表 52 :A 和 D 如表 46 中所列

[0640] $J = 2 - \triangleleft$; $X = 4\text{-CH}_3$; $Y = 6\text{-CH}_3$ 。

[0641] 表 53 :A 和 D 如表 46 中所列

[0642] $J = 2 - \triangleleft$; $X = 6\text{-C}_2\text{H}_5$; $Y = 4\text{-CH}_3$ 。

[0643] 表 54 :A 和 D 如表 46 中所列

[0644] $J = 2 - \triangleleft$; $X = 6\text{-CH}_3$; $Y = 4\text{-Cl}$ 。

[0645] 表 55 :A 和 D 如表 46 中所列

[0646] $J = 2 - \triangleleft$; $X = 6\text{-C}_2\text{H}_5$; $Y = 4\text{-Cl}$ 。

[0647] 表 56 :A 和 D 如表 46 中所列

[0648] $J = 2 - \triangleleft$; $X = 6\text{-Cl}$; $Y = 4\text{-CH}_3$ 。

[0649] 表 57 :A 和 D 如表 46 中所列

[0650] $J = 2 - \triangleleft$; $X = 5\text{-CH}_3$; $Y = 4\text{-CH}_3$ 。

[0651] 表 58 :A 和 D 如表 46 中所列

[0652] $X = 2\text{-CH}_3$; $J = 4 - \triangleleft$; $Y = \text{H}$ 。

[0653] 表 59 :A 和 D 如表 46 中所列

[0654] $X = 2\text{-C}_2\text{H}_5$; $J = 4 - \triangleleft$; $Y = \text{H}$ 。

[0655] 表 60 :A 和 D 如表 46 中所列

[0656] $X = 2\text{-CH}_3$; $J = 4 - \triangleleft$; $Y = 6\text{-CH}_3$ 。

[0657] 表 61 :A 和 D 如表 46 中所列

[0658] $X = 2\text{-C}_2\text{H}_5$; $J = 4 - \triangleleft$; $Y = 6\text{-CH}_3$ 。

[0659] 表 62 :A 和 D 如表 46 中所列

[0660] $X = 2\text{-C}_2\text{H}_5$; $J = 4 - \triangleleft$; $Y = 6\text{-C}_2\text{H}_5$ 。

[0661] 表 63 :A 和 D 如表 46 中所列

[0662] $X = 2\text{-Cl}$; $J = 4 - \triangleleft$; $Y = 6\text{-CH}_3$ 。

[0663] 表 64 :A 和 D 如表 46 中所列

[0664] $X = 2\text{-Cl}$; $J = 4 - \triangleleft$; $Y = 6\text{-C}_2\text{H}_5$ 。

[0665] 表 65 :A 和 D 如表 46 中所列

[0666] $X = 2\text{-CH}_3$; $J = 4 - \triangleleft$; $Y = 5\text{-CH}_3$ 。

[0667] 表 66 :A 和 D 如表 46 中所列

[0668] $X = 2\text{-CH}_3$; $J = 3 - \triangleleft$; $Y = 6\text{-CH}_3$ 。

[0669] 表 67 :A 和 D 如表 46 中所列

[0670] $J = 2 - \triangleleft$; $X = 5\text{-CH}_3$; $Y = \text{H}$ 。

[0671] 表 68 :A 和 D 如表 46 中所列

[0672] $J = 2 - \triangleleft$; $X = 5 - \triangleleft$; $Y = \text{H}$ 。

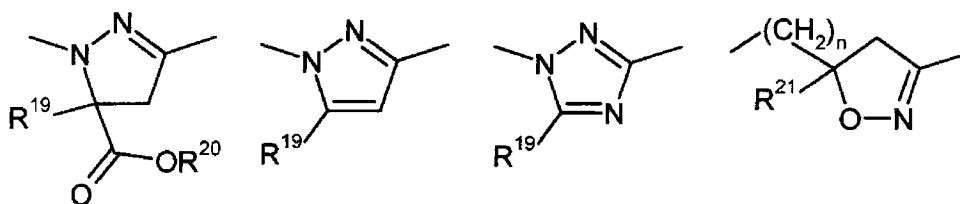
[0673] 与式 (IIa)、(IIb)、(IIc)、(IId) 和 (IIe) 的改进作物植物相容性的化合物) “除

草剂安全剂”)相关的上述基团的优选定义在下面进行限定。

[0674] m 优选代表数值 0、1、2、3 或 4。

[0675] A¹ 优选代表以下所示二价杂环基团之一

[0676]



[0677] n 优选代表数值 0、1、2、3 或 4。

[0678] A² 优选代表各自任选被甲基、乙基、甲氧基羰基或乙氧基羰基取代的亚甲基或亚乙基。

[0679] R¹⁴ 优选代表羟基、巯基、氨基、甲氧基、乙氧基、正丙基、异丙基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、正丙硫基、异丙硫基、正丁硫基、异丁硫基、仲丁硫基、叔丁硫基、甲氨基、乙氨基、正丙氨基、异丙氨基、正丁氨基、异丁氨基、仲丁氨基、叔丁氨基、二甲氨基或二乙氨基。

[0680] R¹⁵ 优选代表羟基、巯基、氨基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、1-甲基己基氧基、烯丙氧基、1-烯丙氧基甲基乙氧基、甲硫基、乙硫基、正丙硫基、异丙硫基、正丁硫基、异丁硫基、仲丁硫基、叔丁硫基、甲氨基、乙氨基、正丙氨基、异丙氨基、正丁氨基、异丁氨基、仲丁氨基、叔丁氨基、二甲氨基或二乙氨基。

[0681] R¹⁶ 优选代表各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的甲基、乙基、正丙基或异丙基。

[0682] R¹⁷ 优选代表氢,各自任选被氟和 / 或氯取代的甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基,甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基乙基、二氧戊环基甲基、呋喃基、呋喃基甲基、噻吩基、噻唑基、哌啶基,或任选被氟、氯、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基取代的苯基。

[0683] R¹⁸ 优选代表氢,各自任选被氟和 / 或氯取代的甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基,甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基乙基、二氧戊环基甲基、呋喃基、呋喃基-甲基、噻吩基、噻唑基、哌啶基,或任选被氟、氯、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基取代的苯基,或与 R¹⁷ 一起代表任选被甲基、乙基、呋喃基、苯基、稠合苯环或被两个与它们所连接的 C 原子一起形成一个 5 元或 6 元碳环的取代基取代的基团 -CH₂-O-CH₂-CH₂- 和 -CH₂-CH₂-O-CH₂-CH₂- 中的一个。

[0684] R¹⁹ 优选代表氢、氰基、氟、氯、溴,或者代表各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的甲基、乙基、正丙基、异丙基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基或苯基。

[0685] R²⁰ 优选代表氢,任选被羟基、氰基、氟、氯、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基取代的甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基。

[0686] R²¹ 优选代表氢、氰基、氟、氯、溴,或者代表各自任选被氟、氯和 / 或溴取代的甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基或苯基。

[0687] X^1 优选代表硝基、氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、二氟甲基、二氯甲基、三氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、氟二氯甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基。

[0688] X^2 优选代表氢、硝基、氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、二氟甲基、二氯甲基、三氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、氟二氯甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基。

[0689] X^3 优选代表氢、硝基、氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、二氟甲基、二氯甲基、三氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、氟二氯甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基。

[0690] t 优选代表数值 0、1、2、3 或 4。

[0691] v 优选代表数值 0、1、2 或 3。

[0692] R^{22} 优选代表氢、甲基、乙基、正丙基或异丙基。

[0693] R^{23} 优选代表氢、甲基、乙基、正丙基或异丙基。

[0694] R^{24} 优选代表氢，各自任选被氰基、氟、氯、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基取代的甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、正丙硫基、异丙硫基、正丁硫基、异丁硫基、仲丁硫基、叔丁硫基、甲氨基、乙氨基、正丙氨基、异丙氨基、正丁氨基、异丁氨基、仲丁氨基、叔丁氨基、二甲氨基或二乙氨基，或者各自任选被氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环丙基氧基、环丁基氧基、环戊基氧基、环己基氧基、环丙基硫基、环丁基硫基、环戊基硫基、环己基硫基、环丙基氨基、环丁基氨基、环戊基氨基或环己基氨基。

[0695] R^{25} 优选代表氢，各自任选被氰基、羟基、氟、氯、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基取代的甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基或仲丁基，各自任选被氰基、氟、氯或溴取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基，或者各自任选被氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基。

[0696] R^{26} 优选代表氢，各自任选被氰基、羟基、氟、氯、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基取代的甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基或仲丁基，各自任选被氰基、氟、氯或溴取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基，各自任选被氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基，或者任选被硝基、氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基取代的苯基，或与 R^{25} 一起代表各自任选被甲基或乙基取代的丁-1,4-二基（三亚甲基）、戊-1,5-二基、1-氧杂丁-1,4-二基或 3-氧杂戊-1,5-二基。

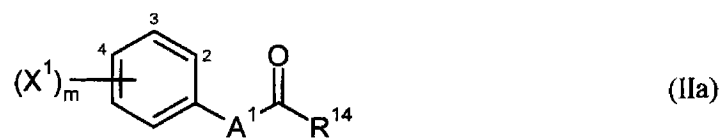
[0697] X^4 优选代表硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、甲酰基、氨基磺酰基、羟基、氨基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基。

[0698] X^5 优选代表硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、甲酰基、氨基磺酰基、羟基、氨基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基。

[0699] 本发明极特别优选的作为除草剂安全剂的式 (IIa) 化合物的实例列于下表中。

[0700] 表式 (IIa) 化合物的实例

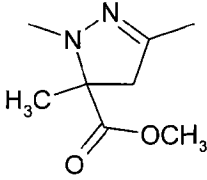
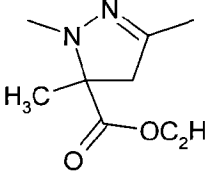
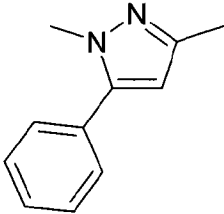
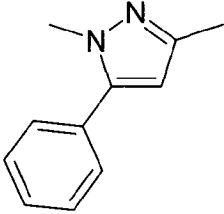
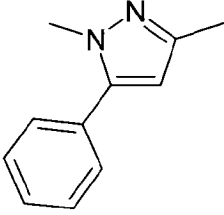
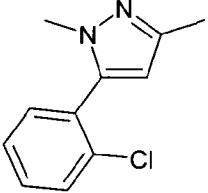
[0701]



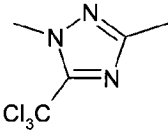
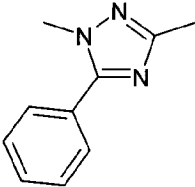
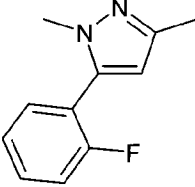
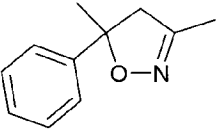
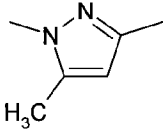
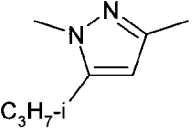
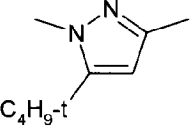
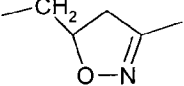
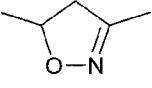
[0702]

实例 序号	(位置) (X¹) _m	A¹	R¹⁴
IIa-1	(2) C1, (4) C1		OCH ₃
IIa-2	(2) C1, (4) C1		OCH ₃

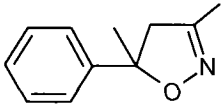
[0703]

实例 序号	(位置) (X ¹) _m	A ¹	R ¹⁴
IIa-3	(2) C1, (4) C1		OC ₂ H ₅
IIa-4	(2) C1, (4) C1		OC ₂ H ₅
IIa-5	(2) C1		OCH ₃
IIa-6	(2) C1, (4) C1		OCH ₃
IIa-7	(2) F		OCH ₃
IIa-8	(2) F		OCH ₃

[0704]

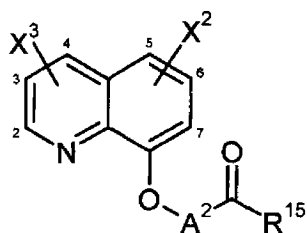
实例 序号	(位置) (X ¹) _m	A ¹	R ¹⁴
IIa-9	(2) C1, (4) C1		OC ₂ H ₅
IIa-10	(2) C1, (4) CF ₃		OCH ₃
IIa-11	(2) C1		OCH ₃
IIa-12	—		OC ₂ H ₅
IIa-13	(2) C1, (4) C1		OC ₂ H ₅
IIa-14	(2) C1, (4) C1		OC ₂ H ₅
IIa-15	(2) C1, (4) C1		OC ₂ H ₅
IIa-16	(2) C1, (4) C1		OC ₂ H ₅
IIa-17	(2) C1, (4) C1		OC ₂ H ₅

[0705]

实例 序号	(位置) (X ¹) _m	A ¹	R ¹⁴
IIa-18	—		OH

[0706] 本发明极特别优选的作为除草剂安全剂的式 (IIb) 化合物的实例列于下表中。

[0707]



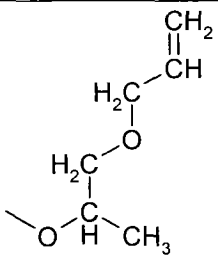
(IIb)

[0708] 表式 (IIb) 化合物的实例

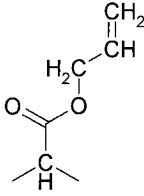
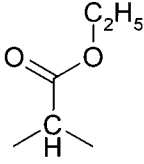
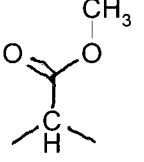
[0709]

实例 序号	(位置) X ²	(位置) X ³	A ²	R ¹⁵
IIb-1	(5) C1	—	CH ₂	OH
IIb-2	(5) C1	—	CH ₂	OCH ₃
IIb-3	(5) C1	—	CH ₂	OC ₂ H ₅
IIb-4	(5) C1	—	CH ₂	OC ₃ H _{7-n}

[0710]

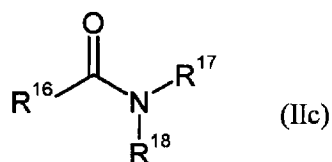
实例 序号	(位置) X^2	(位置) X^3	A^2	R^{15}
IIb-5	(5) C1	—	CH_2	OC_3H_7-i
IIb-6	(5) C1	—	CH_2	OC_4H_9-n
IIb-7	(5) C1	—	CH_2	$OCH(CH_3)C_5H_{11}-n$
IIb-8	(5) C1	(2) F	CH_2	OH
IIb-9	(5) C1	(2) C1	CH_2	OH
IIb-10	(5) C1	—	CH_2	$OCH_2CH=CH_2$
IIb-11	(5) C1	—	CH_2	OC_4H_9-i
IIb-12	(5) C1	—	CH_2	

[0711]

实例 序号	(位置) X^2	(位置) X^3	A^2	R^{15}
IIb-13	(5) C1	—		$OCH_2CH=CH_2$
IIb-14	(5) C1	—		OC_2H_5
IIb-15	(5) C1	—		OCH_3

[0712] 本发明极特别优选的作为除草剂安全剂的式 (IIc) 化合物的实例列于下表中。

[0713]

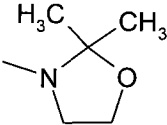
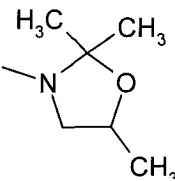
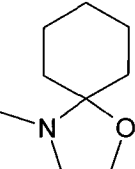
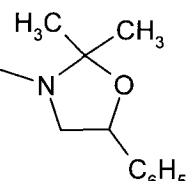
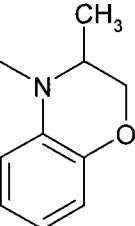
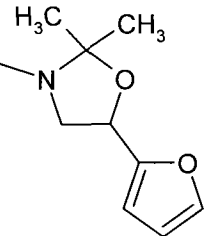


[0714] 表式 (IIc) 化合物的实例

[0715]

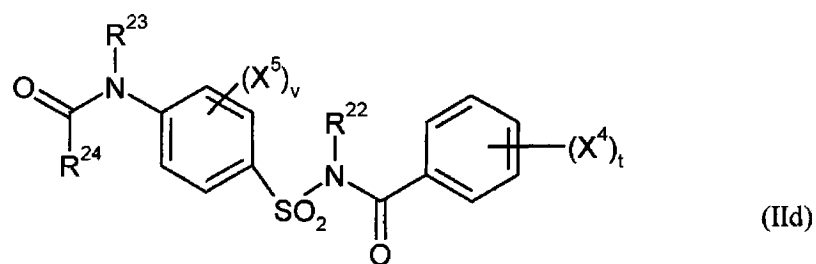
实例 序号	R^{16}	$N(R^{17}, R^{18})$
IIc-1	CHCl_2	$N(\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2)_2$

[0716]

实例 序号	R^{16}	$N(R^{17}, R^{18})$
IIc-2	$CHCl_2$	
IIc-3	$CHCl_2$	
IIc-4	$CHCl_2$	
IIc-5	$CHCl_2$	
IIc-6	$CHCl_2$	
IIc-7	$CHCl_2$	

[0717] 本发明极特别优选的作为除草剂安全剂的式 (IIId) 化合物的实例列于下表中。

[0718]



[0719] 表式 (IIId) 化合物的实例

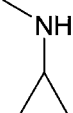
[0720]

实例 序号	R^{22}	R^{23}	R^{24}	(位置) $(X^4)_t$	(位置) $(X^5)_v$
IIId-1	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃	—
IIId-2	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃	—
IIId-3	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃	—
IIId-4	H	H	C ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃	—
IIId-5	H	H		(2) OCH ₃	—
IIId-6	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	—
IIId-7	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	—
IIId-8	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	—

[0721]

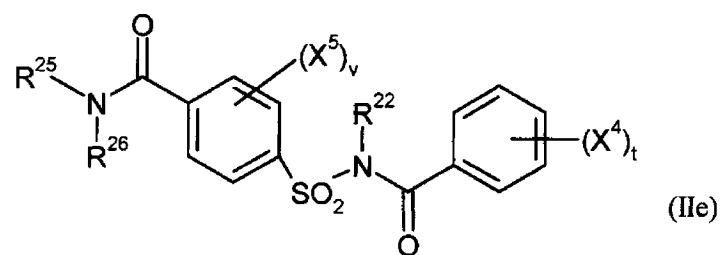
实例 序号	R^{22}	R^{23}	R^{24}	(位置) $(X^4)_t$	(位置) $(X^5)_v$
IIId-9	H	H	C_3H_7-i	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IIId-10	H	H		(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IIId-11	H	H	OCH_3	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IIId-12	H	H	OC_2H_5	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IIId-13	H	H	OC_3H_7-i	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IIId-14	H	H	SCH_3	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IIId-15	H	H	SC_2H_5	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IIId-16	H	H	SC_3H_7-i	(2) OCH_3 (5) CH_3	—

[0722]

实例 序号	R^{22}	R^{23}	R^{24}	(位置) $(X^4)_t$	(位置) $(X^5)_v$
IId-17	H	H	$NHCH_3$	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-18	H	H	NHC_2H_5	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-19	H	H	NHC_3H_7-i	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-20	H	H		(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IId-21	H	H	$NHCH_3$	(2) OCH_3	—
IId-22	H	H	NHC_3H_7-i	(2) OCH_3	—
IId-23	H	H	$N(CH_3)_2$	(2) OCH_3	—
IId-24	H	H	$N(CH_3)_2$	(3) CH_3 (4) CH_3	—
IId-25	H	H	CH_2-O-CH_3	(2) OCH_3	—

[0723] 本发明极特别优选的作为除草剂安全剂的式 (IIe) 化合物的实例列于下表中。

[0724]



[0725] 表式 (IIe) 化合物的实例

[0726]

实例 序号	R^{22}	R^{25}	R^{26}	(位置) $(X^4)_t$	(位置) $(X^5)_v$
IIe-1	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃	—
IIe-2	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃	—
IIe-3	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃	—
IIe-4	H	H	C ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃	—
IIe-5	H	H		(2) OCH ₃	—
IIe-6	H	CH ₃	CH ₃	(2) OCH ₃	—
IIe-7	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	—
IIe-8	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	—
IIe-9	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	—

[0727]

实例 序号	R^{22}	R^{25}	R^{26}	(位置) $(X^4)_t$	(位置) $(X^5)_v$
IIe-10	H	H	C_3H_7-i	(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IIe-11	H	H		(2) OCH_3 (5) CH_3	—
IIe-12	H	CH_3	CH_3	(2) OCH_3 (5) CH_3	—

[0728] 最优选的改进作物植物相容性的化合物〔组分(b')〕为解草酯、解草唑、双苯噁唑酸、吡唑解草酯、解草恶唑、解草啉、苄草隆、杀草隆、哌草丹及化合物 IIe-5 和 IIe-11, 并且特别强调解草酯和吡唑解草酯。

[0729] 用作本发明安全剂的通式 (IIa) 的化合物为已知和 / 或可通过本身已知的方法制备 (参见 WO-A-91/07874、WO-A-95/07897)。

[0730] 用作本发明安全剂的通式 (IIb) 的化合物为已知和 / 或可通过本身已知的方法制备 (参见 EP-A-191736)。

[0731] 用作本发明安全剂的通式 (IIc) 的化合物为已知和 / 或可通过本身已知的方法制备 (参见 DE-A-2218097、DE-A-2350547)。

[0732] 用作本发明安全剂的通式 (IId) 的化合物为已知和 / 或可通过本身已知的方法制备 (参见 DE-A-19621522/US-A-6235680)。

[0733] 用作本发明安全剂的通式 (IIe) 的化合物为已知和 / 或可通过本身已知的方法制备 (参见 WO-A-99/66795/US-A-6251827)。

[0734] 本发明的各自含有一种式 (I) 活性化合物和一种以上定义的安全剂的选择性除草剂结合物的实例列于下表中。

[0735] 表 本发明结合物的实例

[0736]

式 (I) 的活性化合物	安全剂
I-1	解草酯
I-1	解草唑
I-1	双苯噁唑酸
I-1	吡唑解草酯
I-1	解草恶唑
I-1	解草啉
I-1	苄草隆

I-1	杀草隆
I-1	哌草丹
I-1	IIe-11
I-1	IIe-5
I-2	解草酯
I-2	解草唑
I-2	双苯噁唑酸
I-2	吡唑解草酯
I-2	解草恶唑
I-2	解草啶
I-2	苄草隆
I-2	杀草隆
I-2	哌草丹
I-2	IIe-11
I-2	IIe-5
I-3	解草酯

[0737] [0738]

式 (I) 的活性化合物	安全剂
I-3	解草唑
I-3	双苯噁唑酸
I-3	吡唑解草酯
I-3	解草恶唑
I-3	解草啶
I-3	苄草隆
I-3	杀草隆
I-3	哌草丹
I-3	IIe-5
I-3	IIe-11
I-4	解草酯
I-4	解草唑
I-4	双苯噁唑酸
I-4	吡唑解草酯
I-4	解草恶唑
I-4	解草啶
I-4	苄草隆
I-4	杀草隆
I-4	哌草丹
I-4	IIe-11
I-4	IIe-5
I-5	解草酯
I-5	解草唑

[0738] [0739]

式 (I) 的活性化合物	安全剂
I-5	双苯噁唑酸
I-5	吡唑解草酯
I-5	解草恶唑
I-5	解草啶
I-5	苄草隆
I-5	杀草隆
I-5	哌草丹
I-5	IIe-5
I-5	IIe-11

I-6	解草酯
I-6	解草唑
I-6	双苯噁唑酸
I-6	吡唑解草酯
I-6	解草恶唑
I-6	解草啶
I-6	苄草隆
I-6	杀草隆
I-6	哌草丹
I-6	IIe-5
I-6	IIe-11
I-7	解草酯
I-7	解草唑
I-7	双苯噁唑酸

[0739] [0740]

式 (I) 的活性化合物	安全剂
I-7	吡唑解草酯
I-7	解草恶唑
I-7	解草啶
I-7	苄草隆
I-7	杀草隆
I-7	哌草丹
I-7	IIe-5
I-7	IIe-11
I-8	解草酯
I-8	解草唑
I-8	双苯噁唑酸
I-8	吡唑解草酯
I-8	解草恶唑
I-8	解草啶
I-8	苄草隆
I-8	杀草隆
I-8	哌草丹
I-8	IIe-5
I-8	IIe-11
I-9	解草酯
I-9	解草唑
I-9	双苯噁唑酸
I-9	吡唑解草酯

[0740] [0741]

式 (I) 的活性化合物	安全剂
I-9	解草恶唑
I-9	解草啶
I-9	苄草隆
I-9	杀草隆
I-9	哌草丹
I-9	IIe-5
I-9	IIe-11
I-10	解草酯
I-10	解草唑
I-10	双苯噁唑酸
I-10	吡唑解草酯

I-10	解草恶唑
I-10	解草啉
I-10	卞草隆
I-10	杀草隆
I-10	哌草丹
I-10	IIe-5
I-10	IIe-11

[0741] 现已出人意料地发现以上定义的通式(I)的环烷基苯基取代的环状酮-烯醇和以上所列组(b')的安全剂(解毒剂)的活性化合物结合物同时具有极好的有用植物的耐受性和特别高的除草活性,并且可用在多种作物中,特别是谷类中(尤其是小麦),也可用在大豆、马铃薯、玉米和稻中,用于选择性防治杂草。

[0742] 本文中,被认为出人意料的是,在许多能够对抗除草剂对作物植物的损害作用的已知安全剂或解毒剂中,只有以上所列组(b')的化合物适宜抵消——几乎完全地抵消——环烷基苯基取代的环状酮-烯醇对作物植物的损害作用,而同时对抵抗杂草的除草活性没有任何严重的不利影响。

[0743] 本文中可强调的是选自组(b')的特别优选与最优选的混合组分的特别有利的效果,特别是对谷类植物的轻度处理,例如,对作物植物小麦、大麦和黑麦,以及玉米和稻。

[0744] 文献中已给出了对多种活性化合物可通过添加铵盐来增加活性的效果的描述。但是,所述盐为具有洗涤作用的盐(例如W095/017817)和/或具有较长的烷基和/或芳基取代基的盐,其具有渗透作用或增加所述活性化合物的溶解度(例如EP-A0453086、EP-A0664081、FR-A2600494、US4844734、US5462912、US5538937、US-A03/0224939、US-A05/0009880、US-A05/0096386)。此外,现有技术仅描述了某些活性化合物的活性和/或所述组合物的某些应用。在还有一些情形中,它们为磺酸盐,其中其酰基部分对昆虫具有麻痹作用(US 2 842 476)。例如,描述了通过硫酸铵来提高除草剂草甘膦(glyphosate)和草丁膦(phosphinothricin)的活性(US 6645 914、EP-A2 0 036 106)。但是,该现有技术中既未公开也未暗示相应的对于杀昆虫剂的活性。

[0745] 还描述了硫酸铵作为配制助剂用于某些活性化合物及应用的用途(W092/16108),但是使用它的目的是为了稳定制剂,而不是为了提高活性。

[0746] 现已完全出人意料地发现,选自环烷基苯基取代的螺环状酮-烯醇类的杀昆虫剂和/或杀螨剂和/或除草剂的活性可通过向即用溶液中添加铵盐或磷盐,或通过所述盐掺入含环烷基苯基取代的环状酮-烯醇的制剂中而得到提高。因此,本发明提供铵盐或磷盐用于提高含有具有杀昆虫和/或杀螨活性的环烷基苯基取代的环状酮-烯醇类活性化合物的作物保护组合物的活性的用途。本发明还提供含有具有杀昆虫活性的环烷基苯基取代的环状酮-烯醇和提高活性的铵盐或磷盐的组合物,具体地不仅包括配制的活性化合物,还包括即用型组合物(喷雾液)。最后,本发明还提供所述组合物用于防治有害昆虫和/或蛛螨和/或不想要的植物的用途。

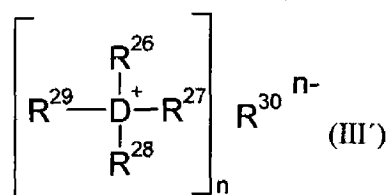
[0747] 式(I)化合物具有广谱的杀昆虫和/或杀螨和/或除草作用;但是,在具体实例中,活性和/或与作物的相容性不令人满意。

[0748] 活性化合物可以宽泛的浓度范围用在本发明的组合物中。本文中,制剂中活性化合物的浓度通常为0.1-50%重量%。

[0749] 根据本发明,能够提高含有脂肪酸生物合成抑制剂的作物保护组合物活性的铵盐

和磷盐通过式 (III') 进行定义

[0750]



[0751] 其中

[0752] D 代表氮或磷，

[0753] D 优选代表氮，

[0754] $R^{26'}$ 、 R^{27} 、 R^{28} 和 R^{29} 相互独立地代表氢，或各自任选被取代的 C_1 - C_8 烷基或者单不饱和或多不饱和的任选被取代的 C_1 - C_8 烯基，其中所述取代基可选自卤素、硝基和氰基，

[0755] $R^{26'}$ 、 R^{27} 、 R^{28} 和 R^{29} 相互独立地优选代表氢，或者各自任选被取代的 C_1 - C_4 烷基，其中所述取代基可选自卤素、硝基和氰基，

[0756] $R^{26'}$ 、 R^{27} 、 R^{28} 和 R^{29} 相互独立地特别优选代表氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基，

[0757] $R^{26'}$ 、 R^{27} 、 R^{28} 和 R^{29} 极特别优选代表氢，

[0758] n 代表 1、2、3 或 4，

[0759] n 优选代表 1 或 2，

[0760] R^{30} 代表一种无机或有机阴离子，

[0761] R^{30} 优选代表碳酸氢根、四硼酸根、氟离子、溴离子、碘离子、氯离子、磷酸一氢根、磷酸二氢根、硫酸氢根、酒石酸根、硫酸根、硝酸根、硫代硫酸根、硫氰酸根、甲酸根、乳酸根、乙酸根、丙酸根、丁酸根、戊酸根或草酸根，

[0762] R^{30} 特别优选代表乳酸根、硫酸根、硝酸根、硫代硫酸根、硫氰酸根、草酸根或甲酸根，

[0763] R^{30} 极特别优选代表硫酸根。

[0764] 本发明尤其优选的活性化合物、盐和渗透剂的结合列于下表中。本文中，表中“渗透剂按照试验”的含义为在表皮渗透试验 (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) 中起渗透剂作用的每一种化合物均是适宜的。

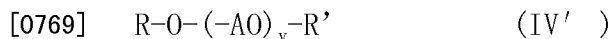
[0765] 式 (III') 的铵盐和磷盐可在宽泛的浓度范围内用于提高含有酮-烯醇的作物保护组合物的活性。一般而言，铵盐或磷盐以 0.5-80mmol/l、优选 0.75-37.5mmol/l、特别优选 1.5-25mmol/l 的浓度用在即用型作物保护组合合物中。对于制剂产品，制剂中铵盐浓度和 / 或磷盐浓度选择为在将该制剂稀释至所需的活性化合物浓度后，其值在所述一般的、优选的或特别优选的范围内。本文中制剂中盐的浓度通常为 1-50 重量%。

[0766] 在本发明的一个优选实施方案中，通过向作物保护组合合物中不仅添加铵盐和 / 或磷盐而且还添加渗透剂来提高活性。被认为完全出人意料的是，甚至在所述情况下观察到甚至更大的活性的提高。因此本发明还提供渗透剂和铵盐和 / 或磷盐的结合物用于提高含有具有杀昆虫活性的环烷基苯基取代的环状酮-烯醇类活性化合物的作物保护组合合物的活性的用途。本发明还提供含有具有杀虫活性的环烷基苯基取代的环状酮-烯醇类、渗透剂和铵盐和 / 或磷盐的组合物，具体地不仅包括配制的活性化合物而且包括即用型组合物

(喷雾液)。最后,本发明还提供所述组合物用于防治有害昆虫的用途。

[0767] 本发明中适宜的渗透剂包括所有那些通常用于促进农用化学活性化合物渗入植物中的物质。渗透剂在本文中通过它们从含水喷雾液和/或从喷雾涂层渗入植物表皮从而提高表皮中活性化合物的流动性的能力进行定义。可使用文献中(Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152)所述方法来确定该特性。

[0768] 适宜的渗透剂有,例如链烷醇烷氧基化物。本发明的渗透剂为式(IV')的链烷醇烷氧基化物



[0770] 其中

[0771] R 代表具有 4-20 个碳原子的直链或支链的烷基,

[0772] R' 代表氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、正戊基或正己基,

[0773] A0 代表氧化亚乙基基团、氧化亚丙基基团、氧化亚丁基基团,或者代表氧化亚乙基基团和氧化亚丙基基团或氧化亚丁基基团的混合物,并且

[0774] v 代表数值 2-30。

[0775] 一组优选的渗透剂为下式的链烷醇烷氧基化物



[0777] 其中

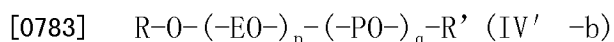
[0778] R 如上定义,

[0779] R' 如上定义,

[0780] EO 代表 $-CH_2-CH_2-O-$, 并且

[0781] n 代表数值 2-20。

[0782] 另一组优选的渗透剂为下式的链烷醇烷氧基化物

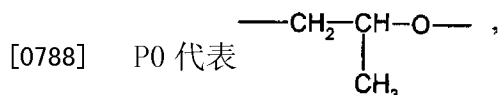


[0784] 其中

[0785] R 如上定义,

[0786] R' 如上定义,

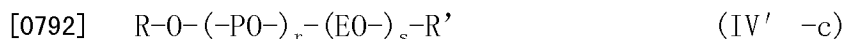
[0787] EO 代表 $-CH_2-CH_2-O-$,



[0789] p 代表数值 1-10, 并且

[0790] q 代表数值 1-10。

[0791] 另一组优选的渗透剂为下式的链烷醇烷氧基化物



[0793] 其中

[0794] R 如上定义,

[0795] R' 如上定义,

[0796] EO 代表 $-CH_2-CH_2-O-$,

[0797] P0 代表 $\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---O---} \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array}$,

[0798] r 代表数值 1-10, 并且

[0799] s 代表数值 1-10。

[0800] 另一组优选的渗透剂为下式的链烷醇烷氧基化物

[0801] $\text{R-O-(-EO-)}_p\text{-(-BO-)}_q\text{-R'}$ (IV' -d)

[0802] 其中

[0803] R 和 R' 如上定义,

[0804] E0 代表 $\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-O-}$,

[0805] B0 代表 $\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH---O---} \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array}$,

[0806] p 代表数值 1-10, 并且

[0807] q 代表数值 1-10。

[0808] 另一组优选的渗透剂为下式的链烷醇烷氧基化物

[0809] $\text{R-O-(-BO-)}_r\text{-(-EO-)}_s\text{-R'}$ (IV' -e)

[0810] 其中

[0811] R 和 R' 如上定义,

[0812] B0 代表 $\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH---O---} \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array}$,

[0813] E0 代表 $\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-O-}$,

[0814] r 代表数值 1-10, 并且

[0815] s 代表数值 1-10。

[0816] 另一组优选的渗透剂为下式的链烷醇烷氧基化物

[0817] $\text{CH}_3\text{-(CH}_2\text{)}_t\text{-CH}_2\text{-O-(-CH}_2\text{-CH}_2\text{-O-)}_u\text{-R'}$ (IV' -f)

[0818] 其中

[0819] R' 如上定义,

[0820] t 代表数值 8-13

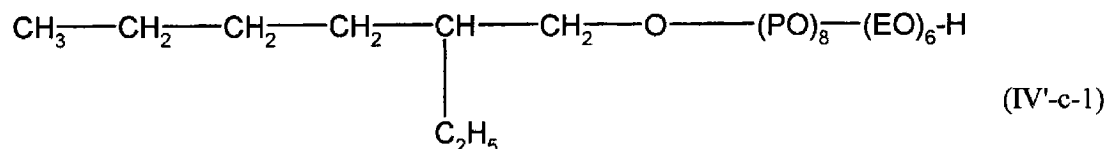
[0821] u 代表数值 6-17。

[0822] 在以上给出的式中,

[0823] R 优选代表丁基、异丁基、正戊基、异戊基、新戊基、正己基、异己基、正辛基、异辛基、2-乙基己基、壬基、异壬基、癸基、正十二烷基、异十二烷基、月桂基、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。

[0824] 可提及的式 (III-c) 链烷醇烷氧基化物的一个实例为下式的 2-乙基己基烷氧基化物

[0825]



[0826] 其中

[0827] E0 代表 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$,

[0828] P0 代表
$$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---O---} \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array},$$
 并且

[0829] 数值 8 和 6 为平均值。

[0830] 可提及的式 (IV-d) 链烷醇烷氧基化物的一个实例为下式

[0831] $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_{10}-\text{O}-(-\text{EO}-)_6-(-\text{BO}-)_2-\text{CH}_3$ (IV' -d-1)

[0832] 其中

[0833] E0 代表 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$,

[0834] B0 代表
$$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH---O---} \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array},$$
 并且

[0835] 数值 10、6 和 2 为平均值。

[0836] 特别优选的式 (IV' -f) 链烷醇烷氧基化物为该式这样的化合物, 其中

[0837] t 代表数值 9-12, 并且

[0838] u 代表数值 7-9。

[0839] 可提及的极特别优选的链烷醇烷氧基化物为式 (IV' -f-1)

[0840] $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_t-\text{CH}_2-\text{O}-(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-)_u-\text{H}$ (IV' -f-1)

[0841] 其中

[0842] t 代表平均值 10.5, 并且

[0843] u 代表平均值 8.4。

[0844] 上式提供了链烷醇烷氧基化物的一般定义。这些物质为具有不同链长的所述类型物质的混合物。因此其下标具有也可偏离整数的平均值。

[0845] 所述式的链烷醇烷氧基化物为已知并且在一些情况下可商购获得或可通过已知方法制备 (参见 W098/35553、W000/35278 和 EP-A0681865)。

[0846] 适宜的渗透剂还包括, 例如, 提高式 (I) 化合物在喷雾涂层中的利用度的物质。所述物质包括, 例如矿物油和植物油。适宜的油为通常可用在农用化学组合物中的改性的或未改性的所有矿物油或植物油。可提及的实例有向日葵油、油菜籽油 (rapeseed oil)、橄榄油、蓖麻油、菜籽油 (colza oil)、玉米籽油、棉籽油和豆油, 或所述油的酯类。优选油菜籽油、向日葵油及其甲基或乙基酯类。

[0847] 本发明组合物中渗透剂的浓度可在宽的范围内变化。对于制剂形式的作物保护物质, 渗透剂的浓度通常为 1-95 重量%, 优选 1-55 重量%, 特别优选 15-40 重量%。在即用型组合物 (喷雾液) 中, 浓度通常在 0.1 和 10g/l 之间, 优选 0.5 和 5g/l 之间。

[0848] 本发明的作物保护组合物还可含有其他组分, 例如表面活性剂和 / 或分散助剂或乳化剂。

[0849] 适宜的非离子表面活性剂和 / 或分散助剂包括通常可用在农用化学组合物中的该类型的所有物质。可优选提及聚环氧乙烷 / 聚环氧丙烷嵌段共聚物、直链醇的聚乙二醇醚类、脂肪酸与环氧乙烷和 / 或环氧丙烷的反应产物, 以及聚乙烯醇、聚乙烯吡咯烷酮、聚乙烯醇与聚乙烯吡咯烷酮的共聚物, 及 (甲基) 丙烯酸与 (甲基) 丙烯酸酯的共聚物, 以及

烷基乙氧基化物和烷基芳基乙氧基化物,它们任选可被磷酸化并任选可用碱中和,可提及的实例有山梨糖醇乙氧基化物,以及聚氧亚烷基胺衍生物。

[0850] 适宜的阴离子表面活性剂为通常可用在农用化学组合物中的该类型的所有物质。优选烷基磺酸或烷基芳基磺酸的碱金属盐及碱土金属盐。

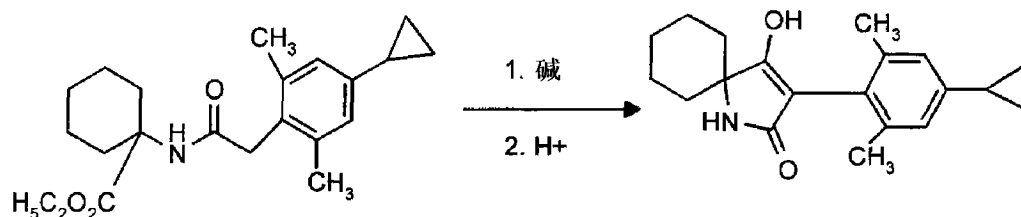
[0851] 其他优选类型的阴离子表面活性剂和 / 或分散助剂为在植物油中具有低溶解度的以下盐:聚苯乙烯磺酸的盐、聚乙烯磺酸的盐、萘磺酸 / 甲醛缩合产物的盐,萘磺酸、苯酚磺酸及甲醛的缩合产物的盐,以及木质磺酸的盐。

[0852] 本发明制剂中可含有的适宜添加剂有乳化剂、泡沫抑制剂、防腐剂、抗氧化剂、着色剂及惰性填充材料。

[0853] 优选的乳化剂有乙氧基化壬基酚、烷基酚与环氧乙烷和 / 或环氧丙烷的反应产物、乙氧基化芳基烷基酚,以及乙氧基化和丙氧基化的芳基烷基酚,以及硫酸化或磷酸化的芳基烷基乙氧基化物和 / 或芳基烷基乙氧丙氧基化物,可提及的实例有脱水山梨糖醇衍生物,例如聚环氧乙烷脱水山梨糖醇脂肪酸酯和脱水山梨糖醇脂肪酸酯。

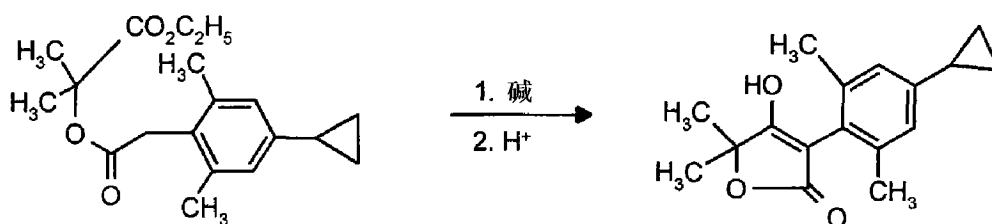
[0854] 根据方法 (A),使用例如 N-(2,6-二甲基-4-环丙基苯乙酰基)-1-氨基环己羧酸乙酯作为原料,本发明该方法的过程可通过以下反应方案表述:

[0855]



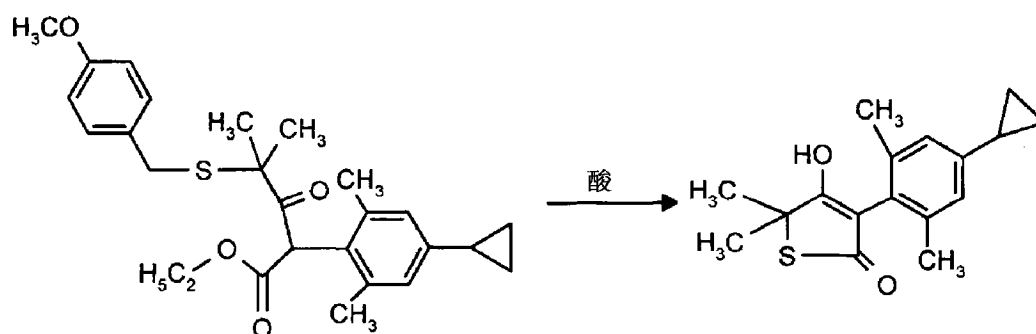
[0856] 根据方法 (B),使用例如 O-(2,6-二甲基-4-环丙基苯乙酰基)-2-羟基异丁酸乙酯,本发明该方法的过程可通过以下反应方案表述:

[0857]



[0858] 根据方法 (C),使用例如 2-(2,6-二甲基-4-环丙基苯基)-4-(4-甲氧基)苄基硫基-4-甲基-3-氧代戊酸乙酯,本发明该方法的过程可通过以下反应方案表述:

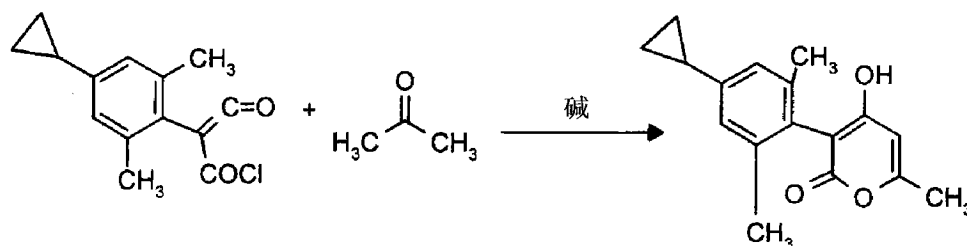
[0859]



[0860] 根据方法 (D),使用例如氯羰基 2-(2,6-二甲基-4-环丙基苯基) 乙烯酮和丙酮作

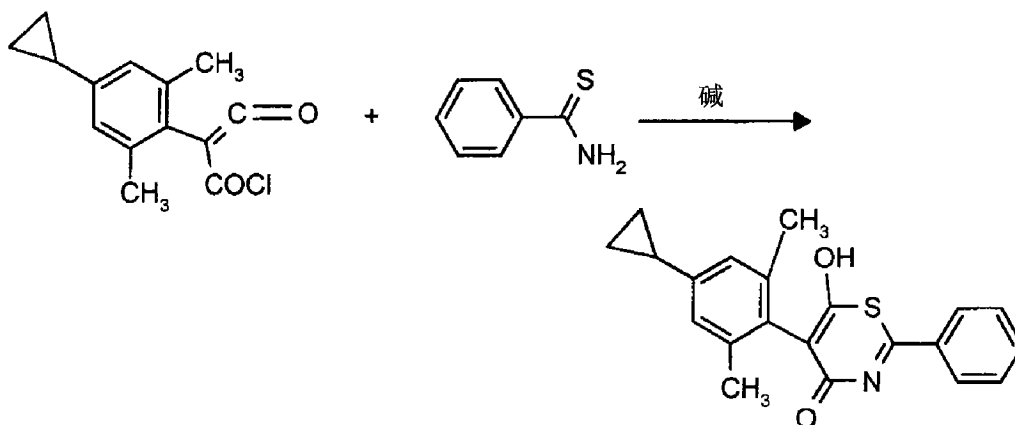
为原料,本发明该方法的过程可通过以下反应方案表述:

[0861]



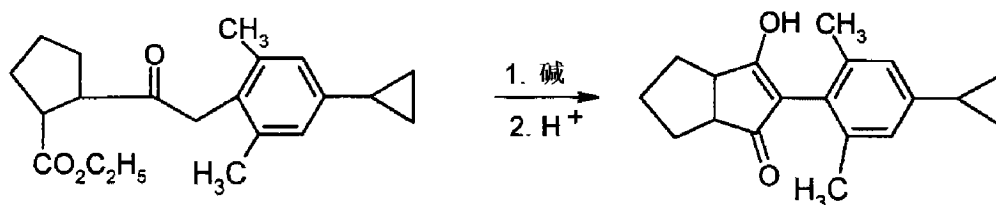
[0862] 根据方法 (E), 使用例如氯羰基 2-(2,6-二甲基-4-环丙基苯基) 乙烯酮和硫代苯甲酰胺作为原料, 本发明该方法的过程可通过以下反应方案表述:

[0863]



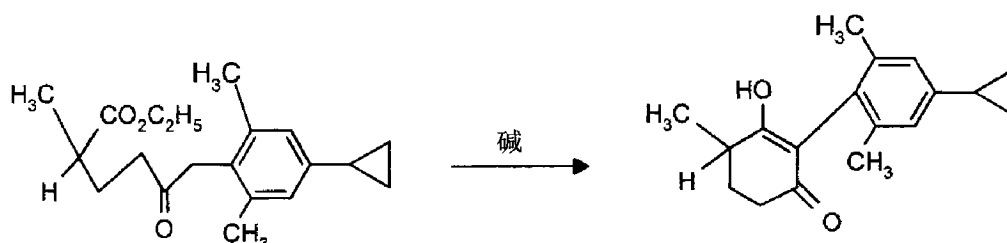
[0864] 根据方法 (F), 使用例如 5-(2,6-二甲基-4-环丙基苯基)-2,3-亚丙基-4-氧代戊酸乙酯, 该本发明方法的过程可通过以下反应方案表述:

[0865]



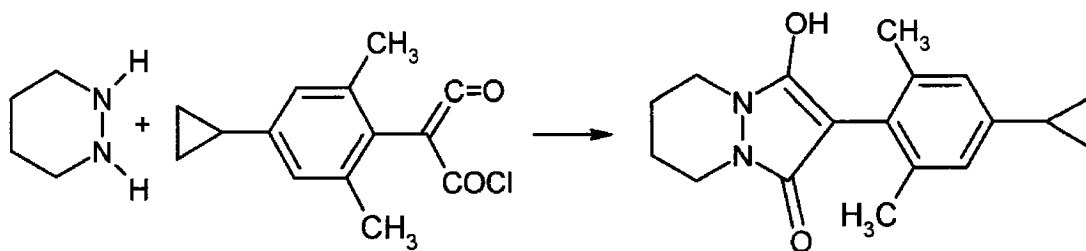
[0866] 根据方法 (G), 使用例如 5-[(2,6-二甲基-4-环丙基) 苯基]-2-甲基-5-氧代己酸乙酯, 该本发明方法的过程可通过以下反应方案表述:

[0867]



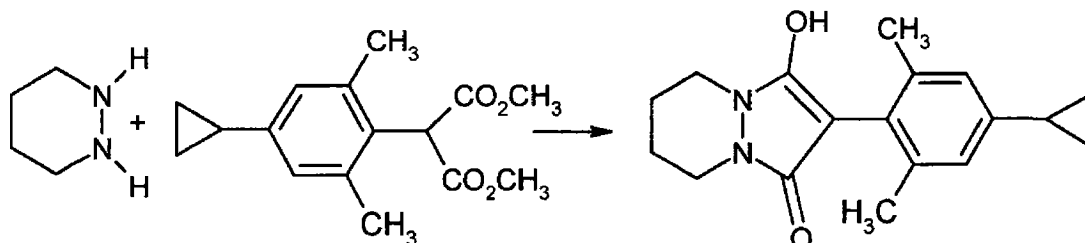
[0868] 根据方法 (H α), 使用例如六氢吡嗪和氯羰基 2-(2,6-二甲基-4-环丙基) 苯基乙烯酮作为原料, 本发明该方法的过程可通过以下反应方案表述:

[0869]



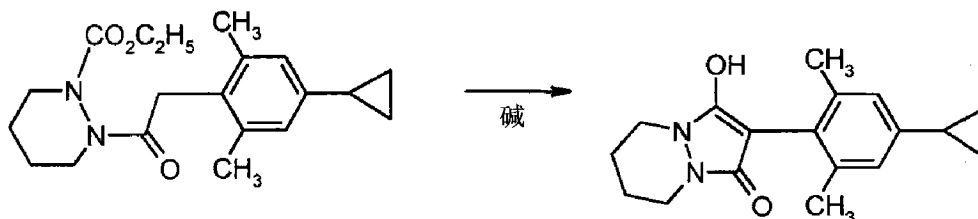
[0870] 根据方法 (Hβ), 使用例如六氢吡嗪和 2-(2,6-二甲基-4-环丙基) 苯基丙二酸二甲酯作为原料, 本发明该方法的过程可通过以下反应方案表述:

[0871]



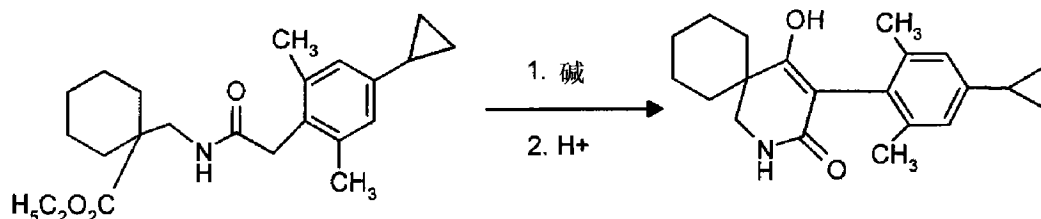
[0872] 根据方法 (Hγ), 使用例如 1-乙氧基羰基-2-[(2,6-二甲基-4-环丙基) 苯乙酰基] 六氢吡嗪作为原料, 该反应的过程可通过以下方案表述:

[0873]



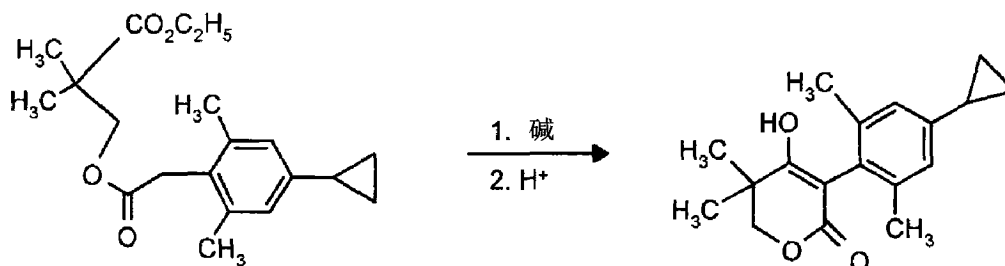
[0874] 根据方法 (I), 使用例如 N-(2,6-二甲基-4-环丙基苯乙酰基)-1-氨基环己羧酸乙酯作为原料, 本发明该方法的过程可通过以下反应方案表述:

[0875]



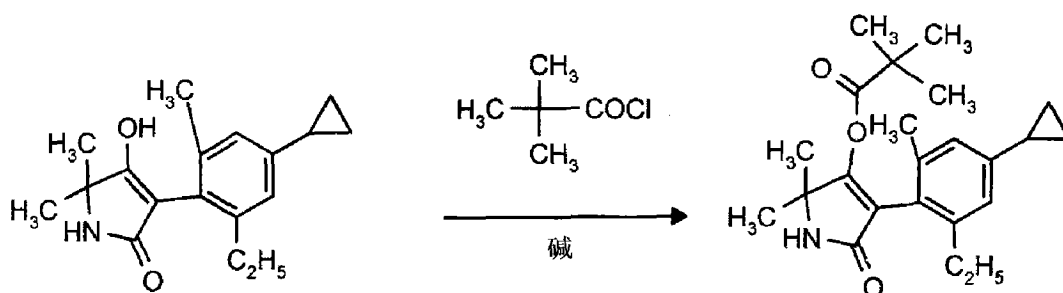
[0876] 根据方法 (J), 使用例如 O-(2,6-二甲基-4-环丙基苯乙酰基)-3-羟基-2,2-二甲基丙酸乙酯, 本发明该方法的过程可通过以下反应方案表述:

[0877]



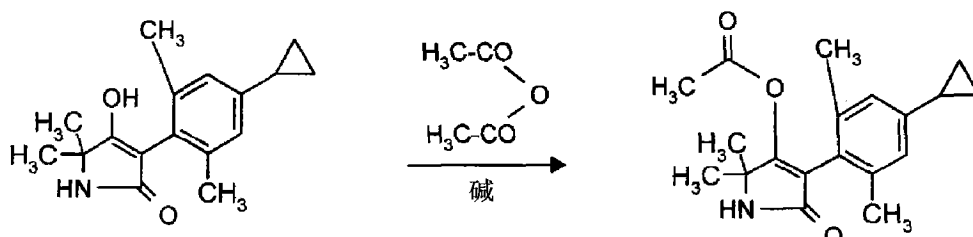
[0878] 根据方法 (Kα), 使用例如 3-(2-甲基-4-环丙基-6-乙基苯基)-5,5-二甲基吡

咯烷-2,4-二酮和新戊酰氯作为原料,本发明该方法的过程可通过以下反应方案表述:
[0879]



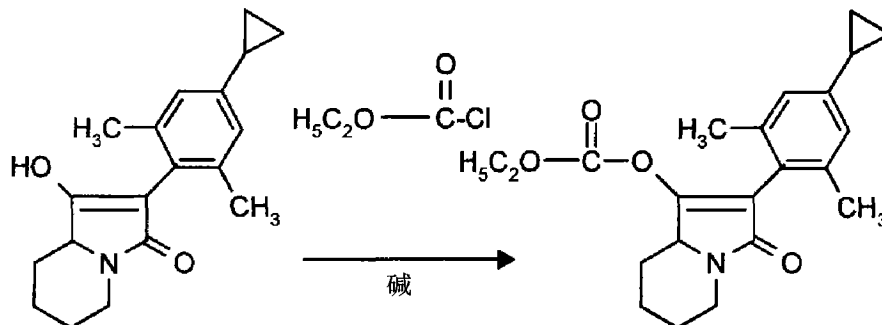
[0880] 根据方法(Kβ),使用例如3-(2,6-二甲基-4-环丙基苯基)-5,5-二甲基吡咯烷-2,4-二酮和乙酸酐作为原料,本发明该方法的过程可通过以下反应方案表述:

[0881]



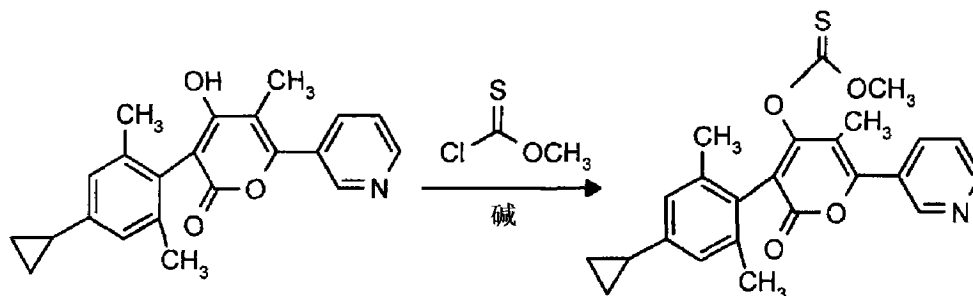
[0882] 根据方法(J),使用例如8-[(2,6-二甲基-4-环丙基)苯基]-1-氮杂双环(4.3.0^{1.6})壬-7,9-二酮和氯甲酸乙酯作为原料,本发明该方法的过程可通过以下反应方案表述:

[0883]



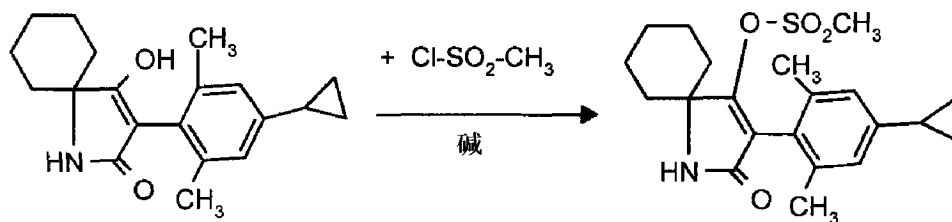
[0884] 根据方法(M),使用例如3-(2,6-二甲基-4-环丙基苯基)-4-羟基-5-甲基-6-(3-吡啶基)吡喃酮和氯单硫代甲酸甲酯作为原料,该反应的过程表述如下:

[0885]



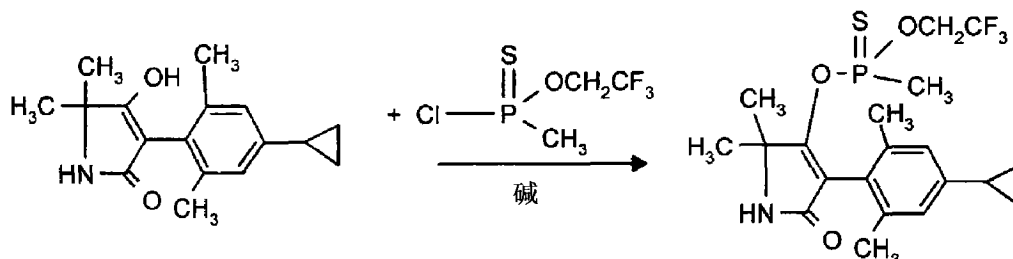
[0886] 根据方法(N),使用例如3-(2,6-二甲基-4-环丙基苯基)-5,5-亚戊基吡咯烷-2,4-二酮和甲磺酰氯作为原料,该反应的过程可通过以下反应方案表述:

[0887]



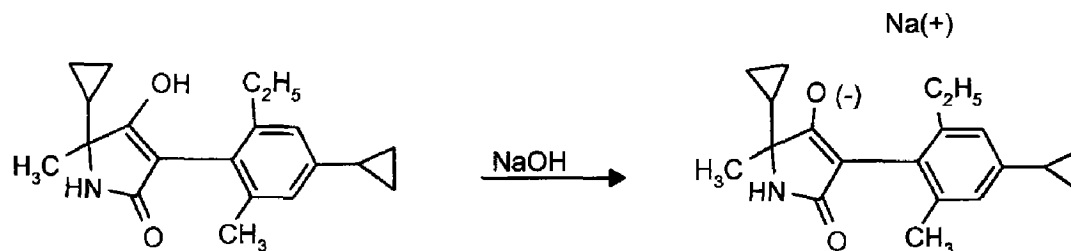
[0888] 根据方法 (O), 使用例如 3-(2,6-二甲基-4-环丙基苯基)-4-羟基-5,5-二甲基吡咯烷-2,4-二酮和 2,2,2-三氟乙基甲硫代膦酰氯作为原料, 该反应的过程可通过以下反应方案表述:

[0889]



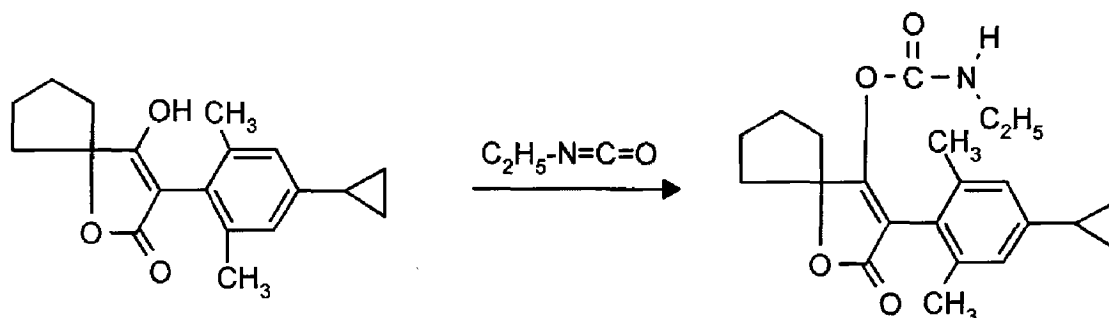
[0890] 根据方法 (P), 使用例如 3-(2-乙基-4-环丙基-6-甲基苯基)-5-环丙基-5-甲基吡咯烷-2,4-二酮和 NaOH 作为组分, 本发明该方法的过程可通过以下反应方案表述:

[0891]



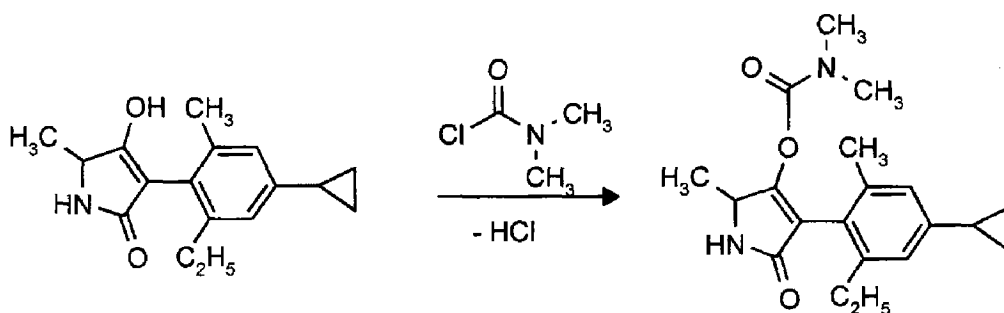
[0892] 根据方法 (Q), 使用例如可变的 α 3-(2,6-二甲基环丙基苯基)-4-羟基-5,5-亚丁基- Δ^3 -二氢呋喃-2-酮和异氰酸乙酯作为原料, 该反应的过程可通过以下反应方案表述:

[0893]



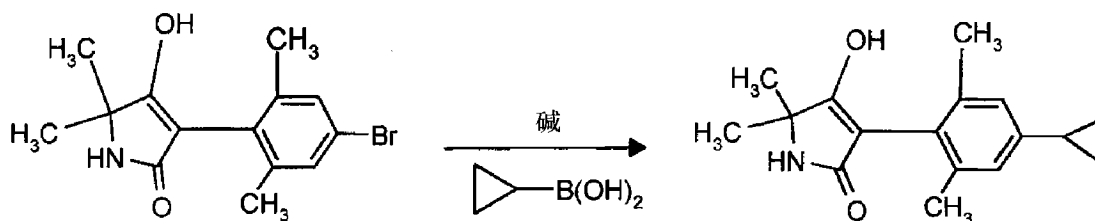
[0894] 根据方法 (Q), 使用例如可变的 β 3-(2-甲基-4-环丙基-6-乙基苯基)-5-甲基吡咯烷-2,4-二酮和二甲基氨基甲酰氯作为原料, 该反应的过程可通过以下方案表述:

[0895]



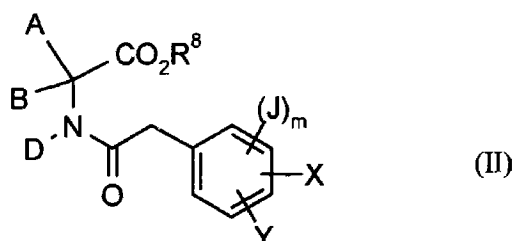
[0896] 根据方法 (R), 使用例如 3-(4-溴-2,6-二甲基苯基)-5,5-二甲基吡咯烷-2,4-二酮和环丙基硼酸作为原料, 该反应的过程可通过以下方案表述:

[0897]



[0898] 本发明方法 (a) 中所需作为原料的式 (II) 化合物是新化合物,

[0899]

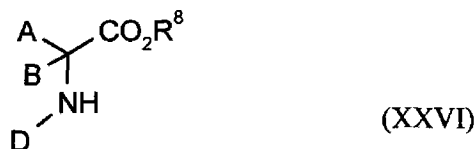


[0900] 其中

[0901] A、B、D、J、m、X、Y 和 R^8 如上定义。

[0902] 式 (II) 酰基氨基酸酯, 当例如用式 (XXVII) 的被取代的苯基乙酸衍生物酰化式 (XXVI) 的氨基酸类衍化物时获得 (Chem. Reviews 52, 237-416 (1953); Bhattacharya, Indian J. Chem. 6, 341-5, 1968), 或者当式 (XXVIII) 的酰基氨基酸被酯化时获得 (Chem. Ind. (London) 1568 (1968)),

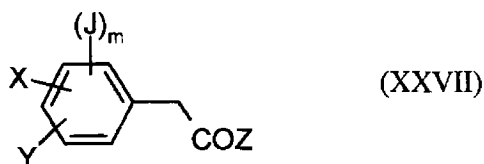
[0903]



[0904] 其中

[0905] A、B、 R^8 和 D 如上定义,

[0906]

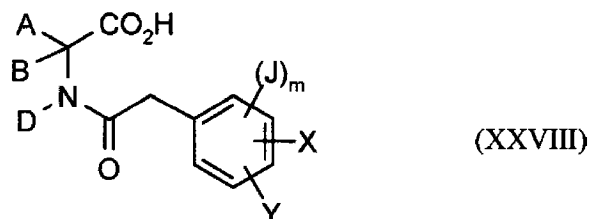


[0907] 其中

[0908] J、m、X 和 Y 如上定义, 并且

[0909] Z 代表由羧酸活化试剂引入的离去基团, 例如羰基二咪唑、碳二亚胺 (例如二环己基碳二亚胺)、磷酸化剂 (例如 POCl_3 、 BOP-Cl)、卤化剂, 例如亚 硫酰氯、草酰氯、光气或氯甲酸酯,

[0910]

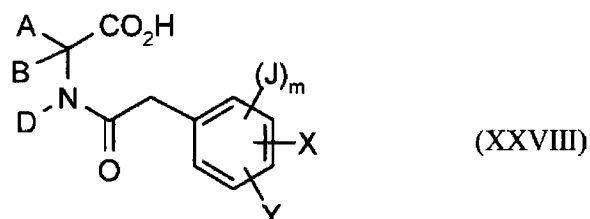


[0911] 其中

[0912] A、B、D、J、m、X 和 Y 如上定义。

[0913] 式 (XXVIII) 的化合物是新化合物,

[0914]



[0915] 其中

[0916] A、B、D、J、m、X 和 Y 如上定义。

[0917] 式 (XXVIII) 的化合物, 例如, 根据 Schotten-Baumann (Organikum, VEBDeutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, p. 505), 当式 (XXIX) 的氨基酸被式 (XXVII) 的被取代的苯乙酸衍生物酰化时获得,

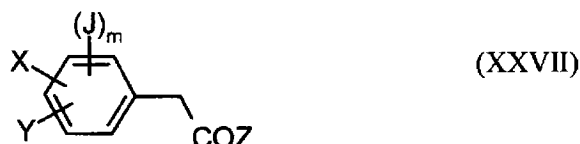
[0918]



[0919] 其中

[0920] A、B 和 D 如上定义,

[0921]



[0922] 其中

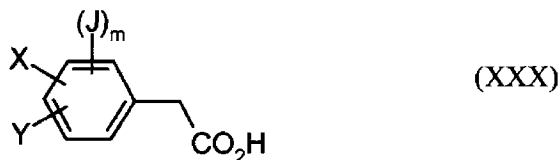
[0923] J、m、X 和 Y 如上定义, 并且

[0924] Z 如上定义。

[0925] 式 (XXVII) 的化合物是新化合物。它们可通过原则上已知的方法制备并示于实例中 (参见, 例如 H. Henecka, Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie [Methods of Organic Chemistry], Vol. 8, pp. 467-469 (1952))。

[0926] 式 (XXVII) 的化合物, 当例如式 (XXX) 的被取代的苯乙酸与卤化剂 (例如亚硫酸氯、亚硫酸溴、草酰氯、光气、三氯化磷、三溴化磷或五氯化磷)、膦羧化剂 (例如 POCl_3 、BOP-Cl)、羰基二咪唑、碳二亚胺 (例如二环己基碳二亚胺) 反应时获得, 反应如果合适在一种稀释剂 (例如任选的氯化脂族或芳香族烃, 例如甲苯或二氯甲烷, 或者酯, 例如四氢呋喃、二噁烷、甲基叔丁基醚) 的存在下、在 -20°C -150°C 、优选 -10°C -100°C 的温度下进行

[0927]



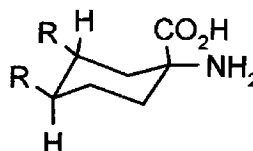
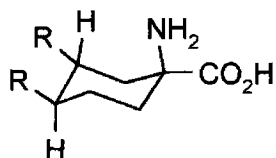
[0928] 其中

[0929] J、m、X 和 Y 如上定义

[0930] 式 (XXVI) 和 (XXIX) 的一些化合物从开篇引用的专利文献中已知, 和 / 或它们可通过已知方法制备 (参见, 例如 Compagnon, Miocque Ann. Chim. (Paris) [14] 5, pp. 11-22, 23-27 (1970))。

[0931] 其中 A 和 B 形成一个环的式 (XXIX) 的被取代的环状氰基羧酸, 一般通过布赫尔-伯格 (Bucherer-Bergs) 合成或通过斯特雷克尔 (Strecker) 合成而获得, 其中它们各自以不同的异构形式而获得。因此, 布赫尔-伯格合成的条件主要提供其中基团 R 和羰基在平伏位置的异构体 (为简便起见, 下文中称为 β), 而斯特雷克尔合成的条件主要提供其中氨基和基团 R 在平伏位置的异构体 (为简便起见, 下文中称为 α)

[0932]



[0933] 布赫尔-伯格合成

斯特雷克尔合成

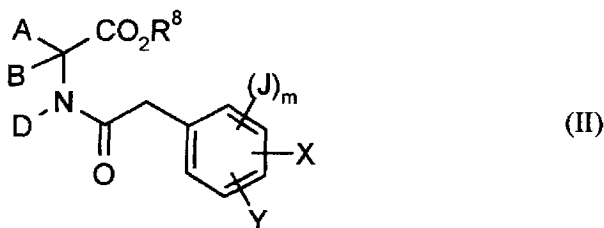
[0934] (β 异构体)

(α 异构体)

[0935] (L. Munday, J. Chem. Soc. 4372 (1961); J. T. Eward, C. Jitrangeri, Can. J. Chem. 53, 3339 (1975))。

[0936] 上述方法 (A) 中使用的式 (II) 的原料, 还可通过将式 (XXXI) 的氨基腈与式 (XXVII) 的被取代的苯乙酸衍生物反应, 生成式 (XXXII) 的化合物, 然后将其进行酸的醇解而制得,

[0937]



[0938] 其中

[0939] A、B、D、J、m、X、Y 和 R^8 如上定义,

[0940]



[0941] 其中

[0942] A、B 和 D 如上定义，

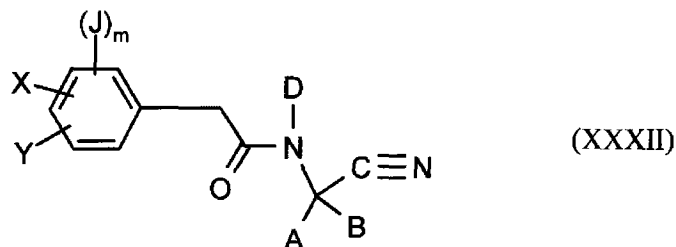
[0943]



[0944] 其中

[0945] J、m、X、Y 和 Z 如上定义，

[0946]



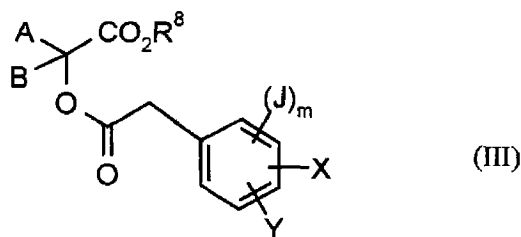
[0947] 其中

[0948] A、B、D、J、m、X 和 Y 如上定义。

[0949] 式 (XXXII) 的化合物也是新化合物。

[0950] 本发明方法 (B) 中所需的原料式 (III) 的化合物是新化合物，

[0951]



[0952] 其中

[0953] A、B、J、m、X、Y 和 R⁸ 如上定义。

[0954] 它们可通过原则上已知的方法制备。

[0955] 从而，式 (III) 的化合物，例如通过将式 (XXXIII-A) 的 2-羟基羧酸酯用式 (XXVII) 的被取代的苯乙酸衍生物酰化而获得 (Chem. Reviews 52, 237-416 (1953))，

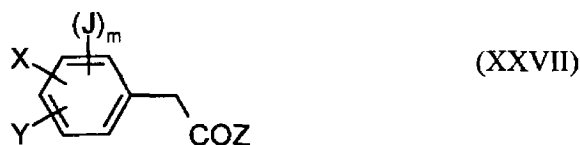
[0956]



[0957] 其中

[0958] A、B 和 R⁸ 如上定义，

[0959]

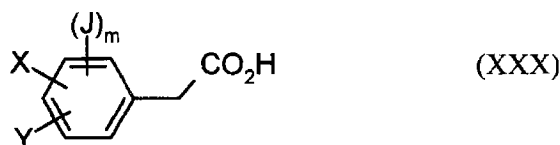


[0960] 其中

[0961] J、m、X、Y 和 Z 如上定义。

[0962] 此外,式 (III) 的化合物,通过将式 (XXX) 的被取代的苯乙酸用式 (XXXIII-B) 的 α -卤代羧酸酯烷基化而获得

[0963]



[0964] 其中

[0965] J、m、X 和 Y 如上定义,

[0966]



[0967] 其中

[0968] A、B 和 R^8 如上定义,并且

[0969] Hal 代表氯或溴。

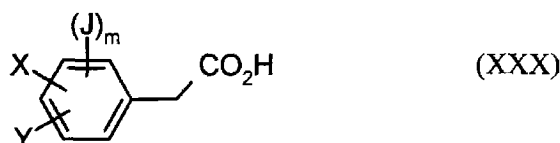
[0970] 式 (XXXIII) 的一些化合物可商购获得,一些是已知的;但是,一些也是新化合物。

[0971] 式 (XXXIII-B) 的化合物可商购获得。

[0972] 式 (XXX) 的化合物是新化合物。

[0973] 式 (XXX) 的化合物,例如当式 (XXXIV) 的苯乙酸在通常已知的标准条件下,在酸或碱的存在下、在一种溶剂的存在下水解时获得,

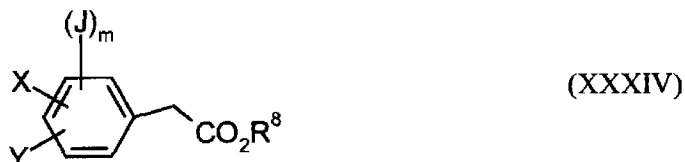
[0974]



[0975] 其中

[0976] J、m、X 和 Y 如上定义,

[0977]



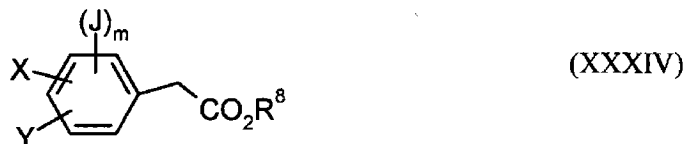
[0978] 其中

[0979] J、m、X、Y 和 R^8 如上定义。

[0980] 式 (XXXIV) 的化合物是新化合物。

[0981] 式 (XXXIV) 的化合物, 通过类似于方法 (R) 的实施例中所述方法, 当式 (XXXIV-a) 的苯乙酸酯在能够耦合的环烷基硼酸衍生物的存在下, 例如环丙基硼酸衍生物的存在下, 在一种碱的存在下, 并且如果合适, 在一种催化剂的存在下 (优选钯盐和一种复合形成体, 例如乙酸钯 / 三环己基膦) 进行反应时获得,

[0982]



[0983] 其中

[0984] J、m、X、Y 和 R⁸ 如上定义,

[0985]



[0986] 其中

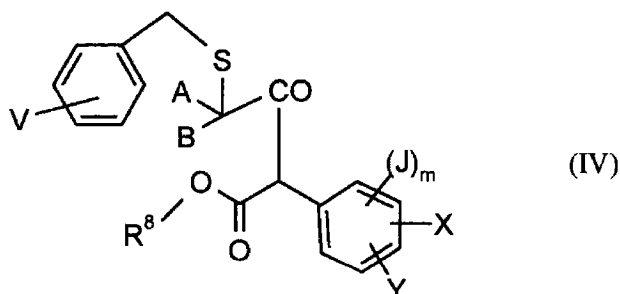
[0987] R⁸、m、X 和 Y 如上定义,

[0988] 并且 J 代表溴或碘。

[0989] 式 (XXXIV-a) 的苯乙酸酯主要已知于例如公开的申请 W096/35664、W097/02243、W097/01535、W098/05638 和 DE-A-10301804, 并且它们可通过这些出版物中所述方法制备。

[0990] 以上方法 (C) 所需原料式 (IV) 化合物是新化合物,

[0991]



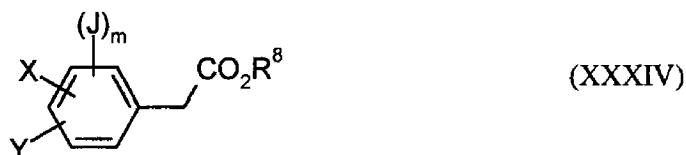
[0992] 其中

[0993] A、B、J、m、V、X、Y 和 R⁸ 如上定义。

[0994] 它们可通过原则上已知的方法制备。

[0995] 式 (IV) 的化合物, 例如当式 (XXXIV) 的被取代的苯乙酸酯在强碱的存在下用式 (XXXV) 的 2-苄基硫代羰基卤化物酰化时获得 (参见, 例如 M. S. Chambers, E. J. Thomas, D. J. Williams, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228),

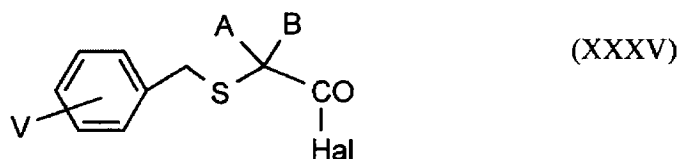
[0996]



[0997] 其中

[0998] J、m、X、Y 和 R^s 如上定义，

[0999]



[1000] 其中

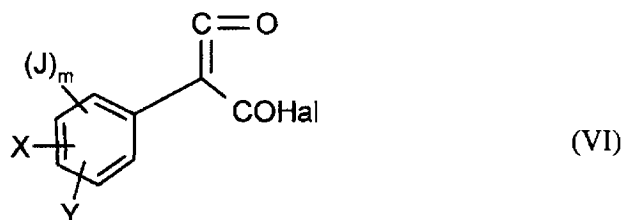
[1001] A、B 和 V 如上定义，并且

[1002] Hal 代表卤素（特别是氯或溴）。

[1003] 一些式 (XXXV) 的苄基硫代羰基卤化物是已知的，和 / 或它们可通过已知方法制备 (J. Ant ibiot ics(1983), 26, 1589)。

[1004] 以上方法 (D)、(E) 和 (H-α) 所需原料式 (VI) 的卤代羰基乙烯酮是新化合物。它们可通过原则上已知的方法制备（参见，例如 Org. Prep. Proced. Int., 7, (4), 155-158, 1975 和 DE1945703）。从而，例如，式 (VI) 的化合物在式 (XXXVI) 的被取代的苯基丙二酸与酰基卤反应时获得，所述酰基卤例如，亚硫酰氯、五氯化磷 (V)、三氯化磷 (III)、草酰氯、光气或亚硫酰溴，反应如果合适在催化剂例如二甲基甲酰胺、甲基硬脂基甲酰胺或三苯基膦的存在下进行，并且如果合适在碱例如吡啶或三乙胺的存在下进行，

[1005]

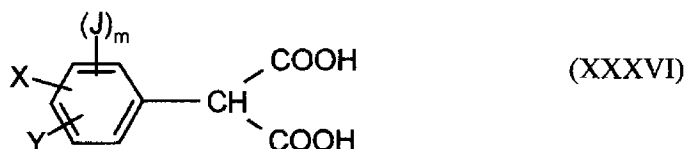


[1006] 其中

[1007] J、m、X 和 Y 如上定义，并且

[1008] Hal 代表氯或溴，

[1009]



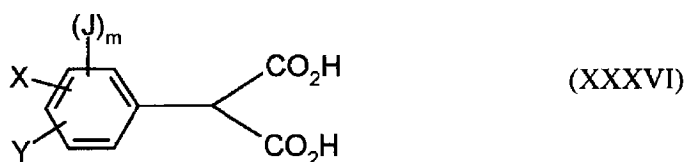
[1010] 其中

[1011] J、m、X 和 Y 如上定义。

[1012] 式 (XXXVI) 的被取代的苯基丙二酸是新化合物。它们可以一种简便方式通过已知方法制备（参见，例如 Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, 第 517 页 及其后面的页码, EP-A-528156、W096/35664、W097/02243、W097/01535、W097/36868 和 W098/05638）。

[1013] 从而式 (XXXVI) 的苯基丙二酸，当式 (XI) 的苯基丙二酸酯先在一种碱和一种溶剂的存在下水解、然后小心地酸化而制得（参见，例如 EP-A-528156、W096/35664、W097/02243），

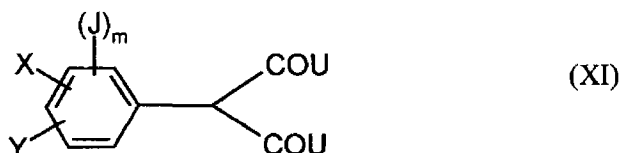
[1014]



[1015] 其中

[1016] J、m、X 和 Y 如上定义，

[1017]



[1018] 其中

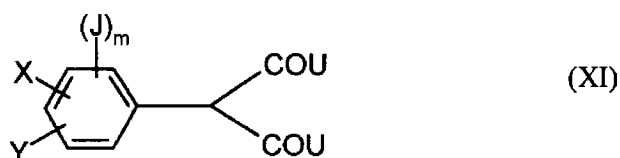
[1019] J、m、X 和 Y 如上定义，

[1020] 并且 U 代表 OR^8 ，

[1021] 其中 R^8 如上定义。

[1022] 式 (XI) 的丙二酸酯是新化合物，

[1023]



[1024] 其中

[1025] J、m、X 和 Y 如上定义

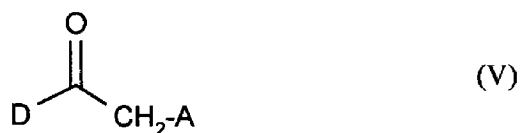
[1026] 并且 U 代表 OR^8 ，

[1027] 其中 R^8 如上定义。

[1028] 它们可通过通常已知的有机化学方法制备（参见，例如 Tetrahedron Lett. 27, 2763(1986), Organikum VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, 第 587 页及其后面的页码, W096/35664、W097/02243、W097/01535、W097/36868、W098/05638 和 W099/47525)。

[1029] 本发明方法 (D) 所需原料式 (V) 的羰基化合物或式 (Va) 的其甲硅烷基烯醇醚为可商购获得的化合物、通常已知的化合物或可通过已知方法获得的化合物，

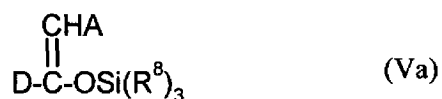
[1030]



[1031] 其中

[1032] A 和 D 如上定义，

[1033]



[1034] 其中

[1035] A、D 和 R^8 如上定义。

[1036] 实施本发明方法 (E) 所需原料式 (VI) 的乙烯酮酰基氯的制备在上面已描述。实施本发明方法 (E) 所需的式 (VII) 的硫代酰胺为有机化学中通常已知的化合物，

[1037]

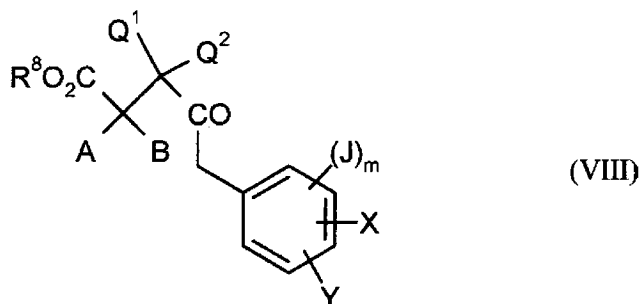


[1038] 其中

[1039] A 如上定义。

[1040] 以上方法 (F) 中所需原料式 (VIII) 的化合物是新化合物，

[1041]



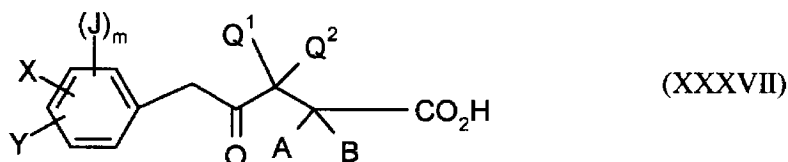
[1042] 其中

[1043] A、B、J、m、 Q^1 、 Q^2 、X、Y 和 R^8 如上定义。

[1044] 它们可通过原则上已知的方法制备。

[1045] 式 (VIII) 的 5-芳基-4-酮羧酸酯，在例如式 (XXXVII) 的 5-芳基-4-酮羧酸酯化时（参见，例如 Organikum, 第 15 版, Berlin, 1977, 第 499 页）或烷基化时获得（参见制备实施例），

[1046]

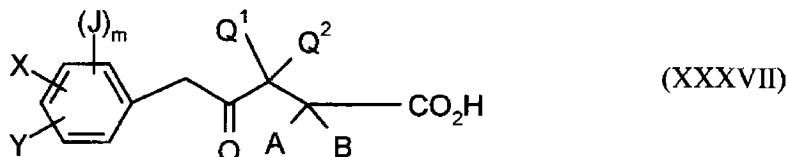


[1047] 其中

[1048] J、m、X、Y、A、B、 Q^1 和 Q^2 如上定义。

[1049] 式 (XXXVII) 的 5-芳基-4-酮羧酸是新化合物；但是，它们可通过原则上已知的方法制备 (W096/01798、W097/14667、W098/39281)，

[1050]



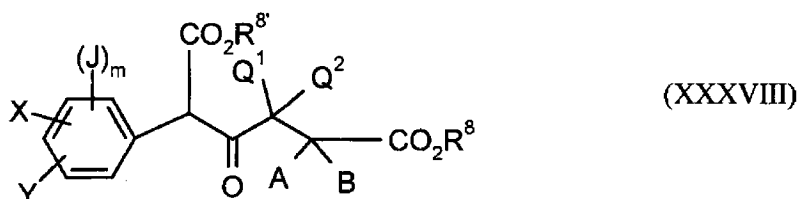
[1051] 其中

[1052] A、B、J、m、 Q^1 、 Q^2 、X 和 Y 如上定义。

[1053] 式 (XXXVII) 的 5-芳基-4-酮羧酸，当例如式 (XXXVIII) 的 2-苯基-3-氧代脂肪

酸酯脱羧时获得,反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种碱或一种酸的存在下进行(参见,例如 Organikum,第15版,Berlin,1977,第519-521页,W096/01798、W097/14667、W098/39281),

[1054]



[1055] 其中

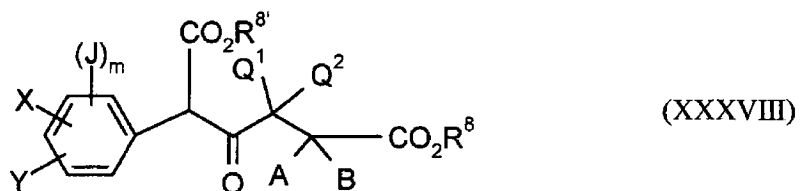
[1056] A、B、J、m、Q¹、Q²、X 和 Y 如上定义,并且

[1057] R⁸ 和 R^{8'} 代表烷基(特别是 C₁-C₈ 烷基),并且

[1058] 当使用式 (XL-a) 的化合物时,R⁸ 代表氢。

[1059] 式 (XXXVIII) 的化合物是新化合物,

[1060]



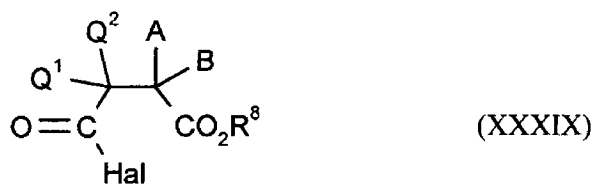
[1061] 其中

[1062] A、B、J、m、Q¹、Q²、X、Y、R⁸、R^{8'} 如上定义,并且

[1063] 当使用式 (XL-a) 的化合物时,R⁸ 代表氢。

[1064] 式 (XXXVIII) 的化合物,当例如式 (XXXIX) 的二羧酸单酯氯化物或式 (XL-a) 的羧酸酐在一种稀释剂的存在下并且在一种碱的存在下用式 (XXXIV) 的苯乙酸酯酰化时获得(参见,例如 M. S. Chambers, E. J. Thomas, D. J. Williams, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228, 以及参见制备实施例),

[1065]

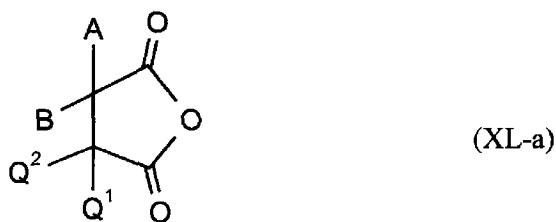


[1066] 其中

[1067] A、B、Q¹、Q² 和 R⁸ 如上定义,并且

[1068] Hal 代表氯或溴,

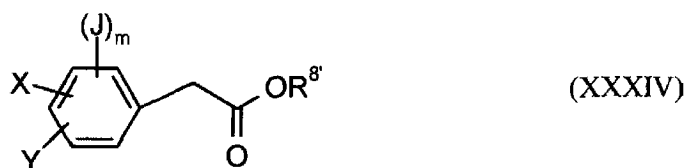
[1069]



[1070] 其中

[1071] A、B、Q¹ 和 Q² 如上定义，

[1072]



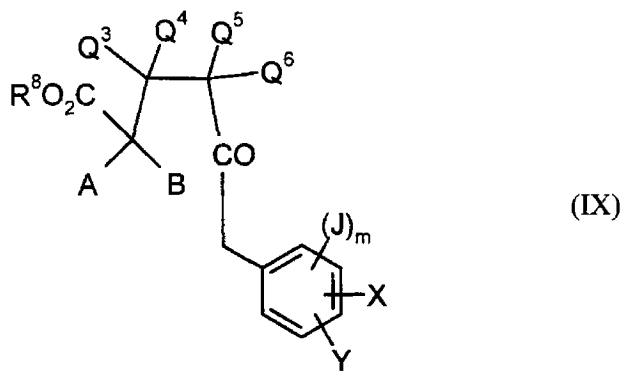
[1073] 其中

[1074] J、m、X、Y 和 R^{8'} 如上定义。

[1075] 一些式 (XXXIX) 和 (XL-a) 的化合物是有机化学的已知化合物，和 / 或它们可通过原则上已知的方法以一种简单方式制备。

[1076] 以上方法 (G) 所需原料式 (IX) 的化合物是新化合物，

[1077]



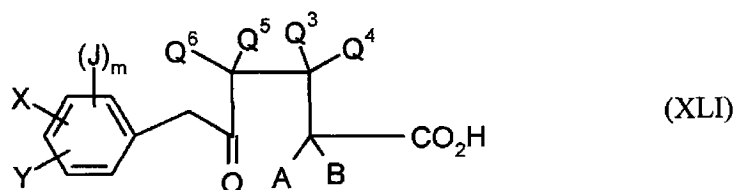
[1078] 其中

[1079] A、B、J、m、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X、Y 和 R⁸ 如上定义。

[1080] 它们可通过原则上已知的方法制备。

[1081] 式 (IX) 的 6-芳基-5-酮羧酸酯，例如在式 (XLI) 的 6-芳基-5-酮羧酸进行酯化时获得（参见，例如 Organikum, 第 15 版, Berlin, 1977, 第 499 页, W099/43649、W099/48869），

[1082]

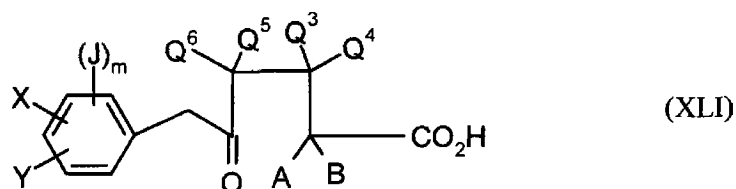


[1083] 其中

[1084] A、B、J、m、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X 和 Y 如上定义。

[1085] 式 (XLI) 的 6-芳基-5-酮羧酸是新化合物。它们可通过原则上已知的方法制备 (W099/43649、W099/48869)，例如在式 (XLII) 的被取代的 2-苯基-3-氧代庚二酸酯进行水解和脱羧时制得，该反应如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种碱或一种酸的存在下进行（参见，例如 Organikum, 第 15 版, Berlin, 1977, 第 519-521 页, W099/43649、W099/48869）

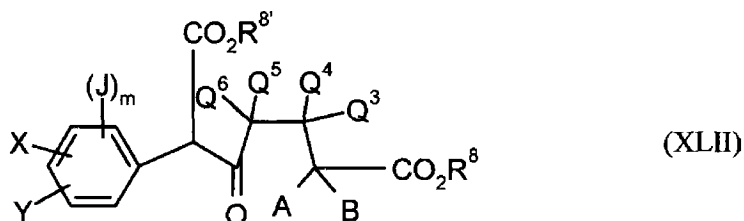
[1086]



[1087] 其中

[1088] A、B、J、m、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X 和 Y 如上定义，

[1089]



[1090] 其中

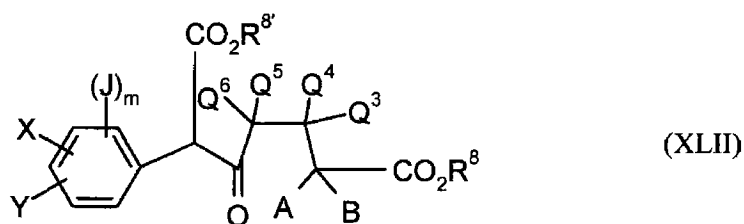
[1091] A、B、J、m、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X 和 Y 如上定义，并且

[1092] R⁸ 和 R^{8'} 代表烷基（优选 C₁-C₆ 烷基），并且

[1093] 当使用式 (XL-b) 的化合物时，R⁸ 代表氢。

[1094] 式 (XLII) 的化合物是新化合物，并且可在一种稀释剂的存在下和在一种碱的存在下通过式 (XLIII) 的二羧酸酯或式 (XL-b) 的羧酸酐与式 (XXXIV) 的被取代的苯乙酸酯进行缩合而获得，

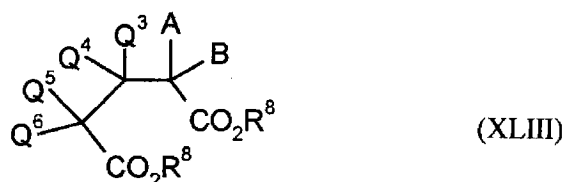
[1095]



[1096] 其中

[1097] A、B、J、m、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X、Y、R⁸ 和 R^{8'} 如上定义，

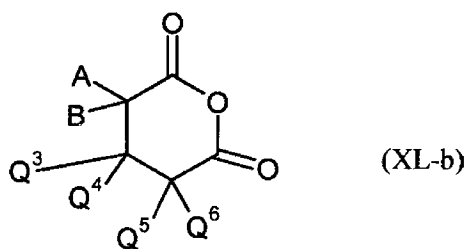
[1098]



[1099] 其中

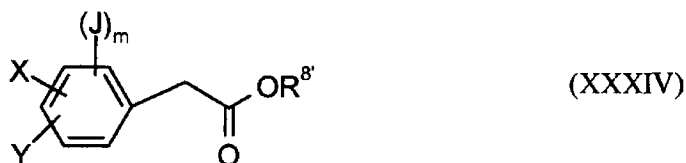
[1100] A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶ 和 R⁸ 如上定义，

[1101]



[1102] 其中 A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶ 如上定义，

[1103]



[1104] 其中

[1105] J、m、X、Y 和 R⁸ 如上定义。

[1106] 一些式 (XLIII) 的化合物是已知的，和 / 或它们可通过已知方法制备。

[1107] 本发明方法 (H-α) 和 (H-β) 所需原料式 (X) 的一些肼类是已知的，和 / 或它们可通过文献中已知的方法制备（参见，例如 Liebigs Ann. Chem. 585, 6 (1954) ; Reaktionen der organischen Synthese [Reactions of Organic Synthesis], C. Ferri, 第 212、513 页 ; Georg Thieme Verlag Stuttgart, 1978 ; Liebigs Ann. Chem. 443, 242 (1925) ; Chem. Ber. 98, 2551 (1965), EP-A-508126、W092/16510、W099/47525、W001/17972),

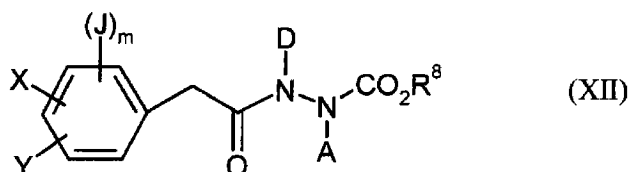
[1108] A-NH-NH-D (X)

[1109] 其中

[1110] A 和 D 如上定义。

[1111] 本发明方法 (H-γ) 所需的式 (XII) 的化合物是新化合物，

[1112]

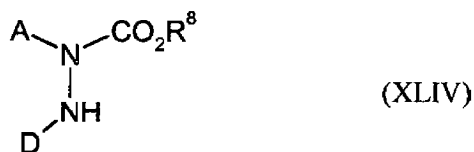


[1113] 其中

[1114] A、D、J、m、X、Y 和 R⁸ 如上定义。

[1115] 式 (XII) 的酰基肼基甲酸酯 (acylcarbazate), 例如在式 (XLIV) 的肼基甲酸酯用式 (XXVII) 的被取代的苯乙酸衍生物酰化时获得 (Chem. Reviews 52, 237-416 (1953) ; Bhattacharya, Indian J. Chem. 6, 341-5, 1968),

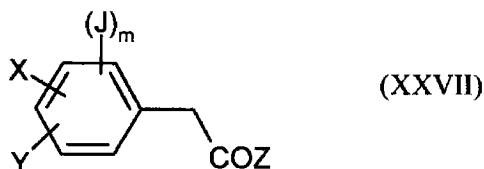
[1116]



[1117] 其中

[1118] A、R⁸ 和 D 如上定义，

[1119]



[1120] 其中

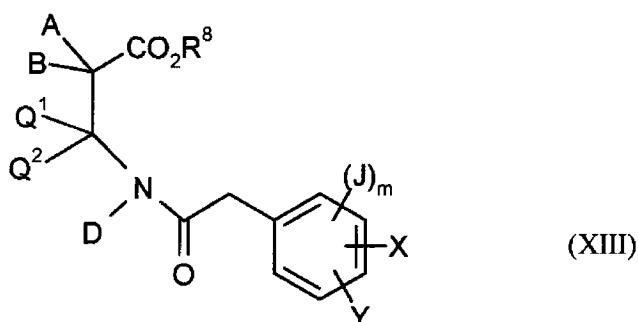
[1121] J、m、X、Y 和 Z 如上定义。

[1122] 式 (XLIV) 的一些胍基甲酸酯可商购获得, 一些为已知化合物, 或者它们可通过原则上已知的有机化学方法制备。

[1123] 已描述了与方法 (A) 和 (B) 的前体有关的式 (XXVII) 的化合物。

[1124] 本发明方法 (I) 所需原料式 (XIII) 的化合物是新化合物,

[1125]

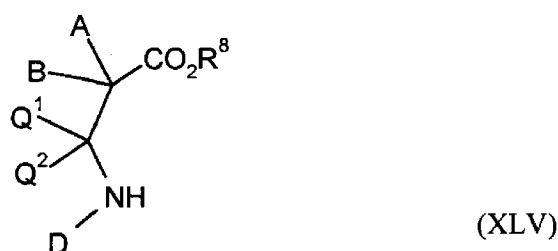


[1126] 其中

[1127] A、B、D、J、m、Q¹、Q²、X、Y 和 R⁸ 如上定义。

[1128] 式 (XIII) 的酰基氨基酸酯, 在例如式 (XLV) 的氰基酸衍生物用式 (XXVII) 的被取代的杂芳基乙酸衍生物酰化时获得 (Chem. Reviews 52, 237-416 (1953); Bhattacharya, Indian J. Chem. 6, 341-5, 1968), 或者当式 (LXVI) 的酰基氨基酸酯化时获得 (Chem. Ind. (London) 1568 (1968)),

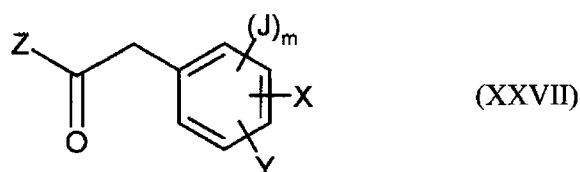
[1129]



[1130] 其中

[1131] A、B、Q¹、Q²、R⁸ 和 D 如上定义,

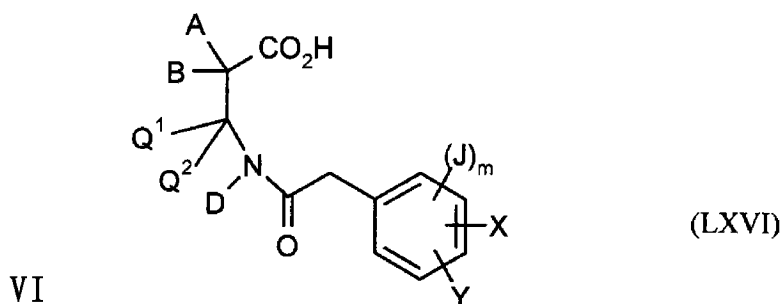
[1132]



[1133] 其中

[1134] J、m、X、Y 和 Z 如上定义,

[1135]

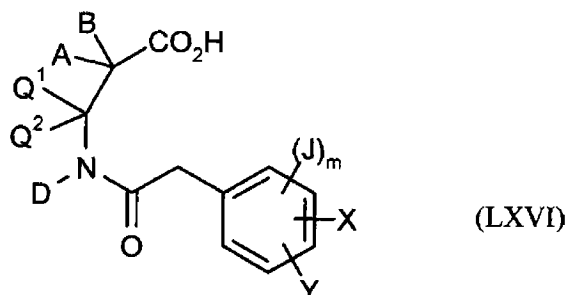


[1136] 其中

[1137] A、B、J、m、D、Q¹、Q²、X 和 Y 如上定义。

[1138] 式 (LXVI) 的化合物是新化合物，

[1139]

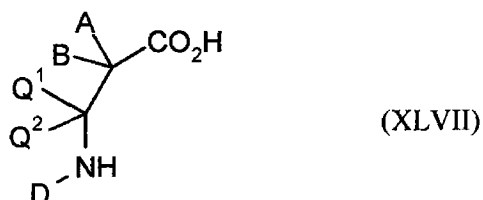


[1140] 其中

[1141] A、B、D、J、m、Q¹、Q²、X 和 Y 如上定义。

[1142] 式 (XLVI) 的化合物,例如根据 Schotten-Baumann,当式 (XLVII) 的 β 氨基酸用式 (XXVII) 的被取代的苯乙酸衍生物酰化时获得 (Organikum, VEBDeutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977,第 505 页),

[1143]



[1144] 其中

[1145] A、B、Q¹、Q² 和 D 如上定义，

[1146]



[1147] 其中

[1148] J、m、X、Y 和 Z 如上定义。

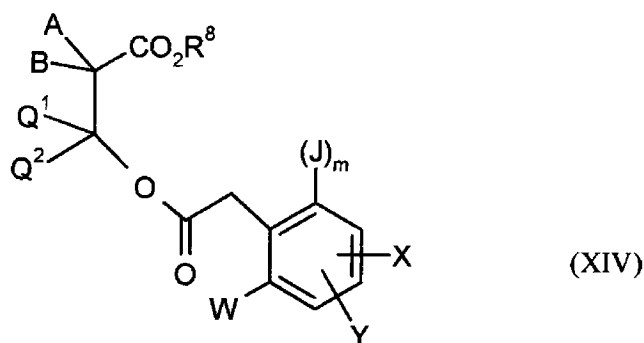
[1149] 式 (XXVII) 的化合物是新化合物。它们可通过原则上已知的方法制备 (参见,例

如 H. Henecka, Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, 第 8 卷, 第 467-469 页 (1952), W097/02243、W099/43699), 或者使用上面所列试剂原位反应生成。

[1150] 式 (XLV) 和 (XLVII) 的一些化合物已知于 W001/79204, 或者它们可通过本申请中给出的原则上已知的方法制备。

[1151] 本发明方法 (J) 所需原料式 (XIV) 的化合物是新化合物,

[1152]

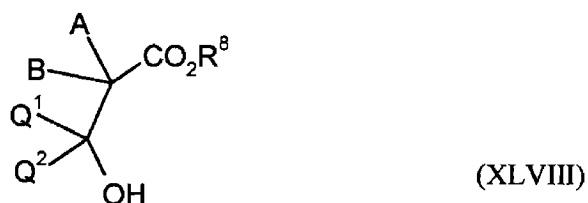


[1153] 其中

[1154] A、B、J、m、Q¹、Q²、X、Y 和 R⁸ 如上定义。

[1155] 式 (XIV) 的酰基羟基羧酸酯, 在例如式 (XLVIII) 的羟基羧酸酯用式 (XXVII) 的被取代的苯乙酸衍生物酰化时获得 (参见式 (II) 的制备实施例),

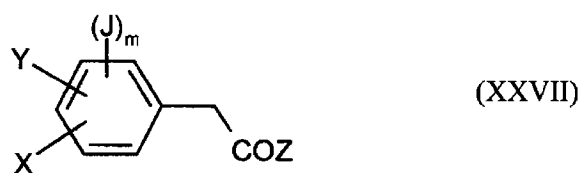
[1156]



[1157] 其中

[1158] A、B、Q¹、Q² 和 R⁸ 如上定义,

[1159]



[1160] 其中

[1161] J、m、X、Y 和 Z 如上定义。

[1162] 式 (XLVIII) 的一些化合物已知于 W001/98288, 或者它们可通过原则上已知的方法制备, 例如通过 Reformatskij 合成 (Organikum, VEBDeutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1990, 第 18 版, 第 501 页及其后面的页码)。

[1163] 式 (XXVII) 的化合物是新化合物。它们可通过原则上已知的方法制备 (参见, 例如 H. Henecka, Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, 第 8 卷, 第 467-469 页 (1952), W097/02243、W099/43649)。

[1164] 实施本发明方法 (K)、(L)、(M)、(N)、(O)、(P)、(Q) 和 (R) 所需的其他原料式 (XV) 的酰基卤、式 (XVI) 的羧酸酐、式 (XVII) 的氯甲酸酯或氯甲酸硫代酯、式 (XVIII) 的氯单硫

代甲酸酯或氯二硫代甲酸酯、式 (XIX) 的磺酰氯、式 (XX) 的磷化合物和式 (XXI) 与 (XXII) 的金属氢氧化物、金属醇盐或胺及式 (XXIII) 的异氰酸酯, 及式 (XXIV) 的甲氨酰氯, 以及式 (XXV) 的环烷基硼酸衍生物是通常已知的有机或无机化学化合物。

[1165] 此外, 式 (V)、(VII)、(X)、(XXVI)、(XXIX)、(XXXI)、(XXXIII-A)、(XXXIII-B)、(XXXV)、(XXXIX)、(XL-a)、(XL-b)、(XLI)、(XLIV)、(XLV)、(XLVII) 和 (XLVIII) 的化合物还已知于开篇引用的专利申请, 和 / 或它们可通过这些申请中给出的方法制备。

[1166] 方法 (A) 的特征在于将式 (II) 的化合物——其中 A、B、D、J、m、X、Y 和 R⁸ 如上所定义——在一种碱的存在下进行分子内缩合。

[1167] 适宜用作本发明方法 (A) 中的稀释剂的为所有惰性的有机溶剂。优选使用烃类, 例如甲苯和二甲苯, 以及醚类, 例如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲醚和二乙二醇二甲醚, 以及极性溶剂, 例如二甲基亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和 N- 甲基吡咯烷酮, 以及醇类, 例如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

[1168] 用于实施本发明方法 (A) 的适宜碱类 (脱质子剂) 为所有常规质子受体。优选使用碱金属和碱土金属的氧化物、氢氧化物和碳酸盐, 例如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙, 它们也可在相转移催化剂的存在下使用, 所述相转移催化剂例如, 三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化铵、Adogen 464 (= 甲基三烷基 (C₈-C₁₀) 氯化铵) 或 TDA1 (= 三 (甲氧基乙氧基乙基) 胺)。也可使用碱金属, 例如钠或钾。也可使用碱金属和碱土金属的氮化物和氢化物, 例如氮化钠、氢化钠和氢化钙, 以及碱金属醇盐, 例如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

[1169] 当实施本发明方法 (A) 时, 反应温度可在相对较宽的范围内变化。一般而言, 本方法在 0°C 和 250°C 之间、优选 50°C 和 150°C 之间的温度实施。

[1170] 本发明方法 (A) 通常在大气压力下实施。

[1171] 当实施本发明方法 (A) 时, 式 (II) 的反应组分和脱质子化碱通常以约双倍等摩尔量使用。但是, 也可使用相对较大程度过量 (最多至 3mol) 的一种或另一种组分。

[1172] 方法 (B) 的特征在于式 (III) 的化合物——其中 A、B、J、m、X、Y 和 R⁸ 如上定义——在一种稀释剂的存在下并且在一种碱的存在下进行分子内缩合。

[1173] 适宜用作本发明方法 (B) 中的稀释剂的为所有惰性有机溶剂。优选使用烃类, 例如甲苯和二甲苯, 以及醚类, 例如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲醚和二乙二醇二甲醚, 以及极性溶剂, 例如二甲基亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和 N- 甲基吡咯烷酮, 以及醇类, 例如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

[1174] 用于实施本发明方法 (B) 的适宜碱类 (脱质子剂) 为所有常规质子受体。优选使用碱金属和碱土金属的氧化物、氢氧化物和碳酸盐, 例如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙, 它们也可在相转移催化剂的存在下使用, 所述相转移催化剂例如, 三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化铵、Adogen 464 (= 甲基三烷基 (C₈-C₁₀) 氯化铵) 或 TDA1 (= 三 (甲氧基乙氧基乙基) 胺)。也可使用碱金属, 例如钠或钾。也可使用碱金属和碱土金属的氮化物和氢化物, 例如氮化钠、氢化钠和氢化钙, 以及碱金属醇盐, 例如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

[1175] 当实施本发明方法 (B) 时, 反应温度可在相对较宽的范围内变化。一般而言, 本方法在 0°C 和 250°C 之间、优选 50°C 和 150°C 之间的温度实施。

[1176] 本发明方法 (B) 通常在大气压力下实施。

[1177] 当实施本发明方法 (B) 时, 式 (II) 的反应组分和脱质子化碱通常以约等摩尔量使用。但是, 也可使用相对较大程度过量 (最多至 3mol) 的一种或另一种组分。

[1178] 方法 (C) 的特征在于式 (IV) 的化合物——其中 A、B、V、J、m、X、Y 和 R⁸ 如上定义——在一种酸的存在下并且如果合适在一种稀释剂的存在下进行分子内环化。

[1179] 用于本发明方法 (C) 的适宜的稀释剂为所有惰性有机溶剂。优选使用烃类, 例如甲苯和二甲苯, 以及卤代烃类, 例如二氯甲烷、氯仿、氯化乙烯、氯苯和二氯苯, 以及极性溶剂, 例如二甲基亚砷、环丁砷、二甲基甲酰胺和 N- 甲基吡咯烷酮。还可使用醇类, 例如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇、叔丁醇。

[1180] 如果需要, 也可将所用酸用作稀释剂。

[1181] 适宜用作本发明方法 (C) 中的酸的为所有常规的无机和有机酸, 例如氢卤酸、硫酸、烷基磺酸、芳基磺酸和卤代烷基磺酸, 特别是卤代烷基羧酸, 例如, 三氟乙酸。

[1182] 当实施本发明方法 (C) 时, 反应温度可在相对较宽的范围内变化。一般而言, 本方法在 0°C 和 250°C 之间、优选 50°C 和 150°C 之间的温度实施。

[1183] 本发明方法 (C) 通常在大气压力下实施。

[1184] 当实施本发明方法 (C) 时, 式 (IV) 的反应组分和酸例如以约等摩尔量使用。但是, 如果合适, 也可用所述酸作为溶剂或催化剂。

[1185] 本发明方法 (D) 的特征在于式 (V) 的羰基化合物或式 (V-a) 中的其烯醇醚类在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸受体的存在下与式 (VI) 的乙烯酮酰基卤进行反应。

[1186] 用于本发明方法 (D) 中的适宜的稀释剂为所有惰性有机溶剂。优选使用任选被卤化的烃类, 例如甲苯、二甲苯、1,3,5- 三甲基苯、氯苯和二氯苯, 以及醚类, 例如二丁醚、乙二醇二甲醚、二乙二醇二甲醚和二苯醚, 以及极性溶剂, 例如二甲基亚砷、环丁砷、二甲基甲酰胺或 N- 甲基吡咯烷酮。

[1187] 用于实施本发明的变型的方法 (D) 的适宜酸受体为所有常规的酸受体。

[1188] 优选使用叔胺, 例如三乙胺、吡啶、二氮杂双环辛烷 (DABCO)、二氮杂双环十一烷 (DBU)、二氮杂双环壬烯 (DBN)、Hünig 碱和 N, N- 二甲基苯胺。

[1189] 当实施本发明的变型的方法 (D) 时, 反应温度可在相对较宽的范围内变化。本方法适宜在 0°C 和 250°C 之间、优选 50°C 和 220°C 之间的温度实施。

[1190] 本发明方法 (D) 适宜在大气压力下实施。

[1191] 当实施本发明方法 (D) 时, 式 (V) 和 (VI) 的反应组分——其中 A、D、J、m、X 和 Y 如上定义并且 Hal 代表卤素, 和如果需要酸受体, 通常以约等摩尔量施用。但是, 也可使用相对较大程度过量 (最多至 5mol) 的一种或另一种组分。

[1192] 本发明方法 (E) 的特征在于式 (VII) 的硫代酰胺在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸受体的存在下与式 (VI) 的乙烯酮酰基卤反应。

[1193] 适宜用作本发明的变型的方法 (E) 的稀释剂的为所有惰性有机溶剂。优选使用烃类, 例如甲苯和二甲苯, 以及醚类, 例如二丁醚、乙二醇二甲醚和二乙二醇二甲醚, 以及极性溶剂, 例如二甲基亚砷、环丁砷、二甲基甲酰胺和 N- 甲基吡咯烷酮。

[1194] 适宜用作实施本发明方法 (E) 的酸受体的为所有常规的酸受体。

[1195] 优选使用叔胺,例如三乙胺、吡啶、二氮杂双环辛烷 (DABCO)、二氮杂双环十一烷 (DBU)、二氮杂双环壬烯 (DBN)、Hünig 碱和 N, N- 二甲基苯胺。

[1196] 当实施本发明方法 (E) 时,反应温度可在相对较宽的范围内变化。本方法适宜在 0°C 和 250°C 之间、优选 20°C 和 220°C 之间的温度实施。

[1197] 本发明方法 (E) 适宜在大气压力下实施。

[1198] 当实施本发明方法 (E) 时,式 (VII) 和 (VI) 的反应组分——其中 A、J、m、X 和 Y 如上定义并且 Hal 代表卤素,和如果合适酸受体,通常以约等摩尔量施用。但是,也可使用相对较大程度过量 (最多至 5mol) 的一种或另一种组分。

[1199] 本发明方法 (F) 的特征在于式 (VIII) 的化合物——其中 A、B、J、m、Q¹、Q²、X、Y 和 R⁸ 如上定义——在一种碱的存在下进行分子内缩合。

[1200] 用于本发明方法 (F) 的适宜的稀释剂为所有对反应参与物呈惰性的有机溶剂。优选使用烃类,例如甲苯和二甲苯,以及醚类,例如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲醚和二乙二醇二甲醚,以及极性溶剂,例如二甲基亚砷、环丁砷、二甲基甲酰胺和 N- 甲基吡咯烷酮。还可使用醇类,例如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇、叔丁醇。

[1201] 用于实施本发明方法 (F) 的适宜碱类 (脱质子剂) 为所有常规的质子受体。优选使用碱金属和碱土金属的氧化物、氢氧化物和碳酸盐,例如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙,它们也可在相转移催化剂的存在下使用,所述相转移催化剂例如,三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化铵、Adogen 464 (甲基三烷基 (C₈-C₁₀) 氯化铵) 或 TDA1 (三 (甲氧基乙氧基乙基) 胺)。也可使用碱金属,例如钠或钾。也可使用碱金属和碱土金属的氮化物和氢化物,例如氮化钠、氮化钾和氮化钙,以及碱金属的醇盐,例如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

[1202] 当实施本发明方法 (F) 时,反应温度可在相对较宽的范围内变化。一般而言,本方法在 -75°C 和 250°C 之间、优选 -50°C 和 150°C 之间的温度实施。

[1203] 本发明方法 (F) 通常在大气压力下实施。

[1204] 当实施本发明方法 (F) 时,式 (VIII) 的反应组分和脱质子碱通常以约等摩尔量施用。但是,也可使用相对较大程度过量 (最多至 3mol) 的一种或另一种组分。

[1205] 本发明方法 (G) 的特征在于式 (IX) 的化合物——其中 A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、J、m、X、Y 和 R⁸ 如上定义——在一种碱的存在下进行分子内缩合。

[1206] 在本发明方法 (G) 中使用的适宜的稀释剂为所有对反应参与物呈惰性的有机溶剂。优选使用烃类,例如甲苯和二甲苯,以及醚类,例如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲醚和二乙二醇二甲醚,以及极性溶剂,例如二甲基亚砷、环丁砷、二甲基甲酰胺和 N- 甲基吡咯烷酮。也可使用醇类,例如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇、叔丁醇。

[1207] 用于实施本发明方法 (G) 的适宜碱类 (脱质子剂) 为所有常规的质子受体。

[1208] 优选使用碱金属和碱土金属的氧化物、氢氧化物和碳酸盐,例如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙,它们也可在相转移催化剂的存在下使用,所述相转移催化剂例如,三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化铵、Adogen 464 (甲基三烷基 (C₈-C₁₀) 氯化铵) 或 TDA1 (三 (甲氧基乙氧基乙基) 胺)。也可使用碱金属,例如钠或钾。也可使用碱金属和碱土金属的氮化物和氢化物,例如氮化钠、氮化钾和氮化钙,以及碱金属的醇盐,例如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

[1209] 当实施本发明方法 (G) 时,反应温度可在相对较宽的范围内变化。一般而言,本方法在 0℃和 250℃之间、优选 50℃和 150℃之间的温度实施。

[1210] 本发明方法 (G) 通常在大气压力下实施。

[1211] 当实施本发明方法 (G) 时,式 (IX) 的反应组分和脱质子碱通常以约等摩尔量施用。但是,也可使用相对较大程度过量(最多至 3mol)的一种或另一种组分。

[1212] 本发明方法 (H-α) 的特征在于式 (X) 的胍类或其盐在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸受体的存在下与式 (VI) 的乙烯酮酰基卤反应。

[1213] 在本发明方法 (H-α) 中使用的适宜的稀释剂为所有惰性有机溶剂。优选使用任选被氯化的烃类,例如 1,3,5-三甲基苯、氯苯和二氯苯、甲苯、二甲苯,以及醚类,例如二丁醚、乙二醇二甲醚、二乙二醇二甲醚和二苯基乙烷,以及极性溶剂,例如二甲基亚砷、环丁砷、二甲基甲酰胺或 N-甲基吡咯烷酮。

[1214] 用于实施本发明的变型的方法 (H-α) 的适宜的酸受体为所有常规的酸受体。

[1215] 优选使用叔胺,例如三乙胺、吡啶、二氮杂双环辛烷 (DABCO)、二氮杂双环十一烷 (DBU)、二氮杂双环壬烯 (DBN)、Hünig 碱和 N,N-二甲基苯胺。

[1216] 当实施本发明的变型的方法 (H-α) 时,反应温度可在相对较宽的范围内变化。本方法适宜在 0℃和 250℃之间、优选 50℃和 220℃之间的温度实施。

[1217] 本发明方法 (H-α) 适宜在大气压力下实施。

[1218] 当实施本发明方法 (H-α) 时,式 (VI) 和 (X) 的反应组分——其中 A、D、J、m、X 和 Y 如上定义并且 Ha1 代表卤素,和如果合适酸受体,通常以约等摩尔量施用。但是,也可使用相对较大程度过量(最多至 5mol)的一种或另一种组分。

[1219] 本发明方法 (H-β) 的特征在于式 (X) 的胍类或其盐——其中 A 和 D 如上定义——在一种碱的存在下与式 (XI) 的丙二酸酯或丙二酰胺——其中 U、J、m、X、Y 和 R⁸ 如上定义——进行缩合。

[1220] 用于本发明方法 (H-β) 中的适宜的稀释剂为所有惰性有机溶剂。优选使用任选被卤化的烃类,例如甲苯、二甲苯、1,3,5-三甲基苯、氯苯和二氯苯,以及醚类,例如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、二苯醚、乙二醇二甲醚和二乙二醇二甲醚,以及极性溶剂,例如二甲基亚砷、环丁砷、二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺和 N-甲基吡咯烷酮,以及醇类,例如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

[1221] 用于实施本发明方法 (H-β) 的适宜碱类(脱质子剂)为所有常规的质子受体。优选使用碱金属和碱土金属的氧化物、氢氧化物和碳酸盐,例如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙,它们也可在相转移催化剂的存在下使用,所述相转移催化剂例如,三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化铵、Adogen 464(=甲基三烷基(C₈-C₁₀)氯化铵)或 TDA1(=三(甲氧基乙氧基乙基)胺)。也可使用碱金属,例如钠或钾。也可使用碱金属和碱土金属的氮化物和氢化物,例如氮化钠、氮化钾和氮化钙,以及碱金属的醇盐,例如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

[1222] 也可使用叔胺,例如三乙胺、吡啶、二氮杂双环辛烷 (DABCO)、二氮杂双环十一烷 (DBU)、二氮杂双环壬烯 (DBN)、Hünig 碱和 N,N-二甲基苯胺。

[1223] 当实施本发明方法 (H-β) 时,反应温度可在相对较宽的范围内变化。一般而言,本方法在 0℃和 280℃之间、优选 50℃和 180℃之间的温度实施。

[1224] 本发明方法 (H-β) 通常在大气压力下实施。

[1225] 当实施本发明方法 (H-β) 时, 式 (VI) 和 (X) 的反应组分通常以约等摩尔量使用。但是, 也可使用相对较大程度过量 (最多至 3mol) 的一种或另一种组分。

[1226] 本发明方法 (H-γ) 的特征在于式 (XII) 的化合物——其中 A、D、J、m、X、Y 和 R⁸ 如上定义——在一种碱的存在下进行分子内缩合。

[1227] 适宜用作本发明方法 (H-γ) 中的稀释剂的为所有惰性有机溶剂。优选使用烃类, 例如甲苯和二甲苯, 以及醚类, 例如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲醚和二乙二醇二甲醚, 以及极性溶剂, 例如二甲基亚砷、环丁砷、二甲基甲酰胺和 N-甲基吡咯烷酮, 以及醇类, 例如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

[1228] 用于实施本发明方法 (H-γ) 的适宜碱类 (脱质子剂) 为所有常规的质子受体。优选使用碱金属和碱土金属的氧化物、氢氧化物和碳酸盐, 例如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙, 它们也可在相转移催化剂的存在下使用, 所述相转移催化剂例如, 三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化铵、Adogen 464 (= 甲基三烷基 (C₈-C₁₀) 氯化铵) 或 TDA1 (= 三 (甲氧基乙氧基乙基) 胺)。也可使用碱金属, 例如钠或钾。也可使用碱金属和碱土金属的氮化物和氢化物, 例如氮化钠、氮化钾和氮化钙, 以及碱金属的醇盐, 例如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

[1229] 当实施本发明方法 (H-γ) 时, 反应温度可在相对较宽的范围内变化。一般而言, 本方法在 0°C 和 250°C 之间、优选 50°C 和 150°C 之间的温度实施。

[1230] 本发明方法 (H-γ) 通常在大气压力下实施。

[1231] 当实施本发明方法 (H-γ) 时, 式 (XII) 的反应组分和脱质子碱通常以约双倍摩尔量施用。但是, 也可使用相对较大程度过量 (最多至 3mol) 的一种或另一种组分。

[1232] 本发明方法 (I) 的特征在于式 (XIII) 的化合物——其中 A、B、D、J、m、Q¹、Q²、X、Y 和 R⁸ 如上定义——在一种碱的存在下进行分子内缩合。

[1233] 适宜用作本发明方法 (I) 中的稀释剂的为所有惰性有机溶剂。优选使用烃类, 例如甲苯和二甲苯, 以及醚类, 例如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲醚和二乙二醇二甲醚, 以及极性溶剂, 例如二甲基亚砷、环丁砷、二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺和 N-甲基吡咯烷酮, 以及醇类, 例如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

[1234] 用于实施本发明方法 (I) 的适宜碱类 (脱质子剂) 为所有常规的质子受体。优选使用碱金属和碱土金属的氧化物、氢氧化物和碳酸盐, 例如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙, 它们也可在相转移催化剂的存在下使用, 所述相转移催化剂例如, 三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化铵、Adogen 464 (= 甲基三烷基 (C₈-C₁₀) 氯化铵) 或 TDA1 (= 三 (甲氧基乙氧基乙基) 胺)。也可使用碱金属, 例如钠或钾。也可使用碱金属和碱土金属的氮化物和氢化物, 例如氮化钠、氮化钾和氮化钙, 以及碱金属的醇盐, 例如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

[1235] 当实施本发明方法 (I) 时, 反应温度可在相对较宽的范围内变化。一般而言, 本方法在 -80°C 和 180°C 之间、优选 -50°C 和 120°C 之间的温度实施。

[1236] 本发明方法 (I) 通常在大气压力下实施。

[1237] 当实施本发明方法 (I) 时, 式 (XIII) 的反应组分和脱质子碱通常以约双倍摩尔量使用。但是, 也可使用相对较大程度过量 (最多至 3mol) 的一种或另一种组分。

[1238] 本发明方法 (J) 的特征在于式 (XIV) 的化合物——其中 A、B、Q¹、Q²、J、m、X、Y 和 R⁸ 如上定义——在一种碱的存在下进行分子内缩合。

[1239] 适宜用作本发明方法 (J) 中的稀释剂的为所有惰性有机溶剂。优选使用烃类，例如甲苯和二甲苯，以及醚类，例如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲醚和二乙二醇二甲醚，以及极性溶剂，例如二甲基亚砷、环丁砷、二甲基甲酰胺和 N-甲基吡咯烷酮，以及醇类，例如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

[1240] 用于实施本发明方法 (J) 的适宜碱类（脱质子剂）为所有常规的质子受体。优选使用碱金属和碱土金属的氧化物、氢氧化物和碳酸盐，例如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙，它们也可在相转移催化剂的存在下使用，所述相转移催化剂例如，三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化铵、Adogen 464（= 甲基三烷基（C₈-C₁₀）氯化铵）或 TDA1（= 三（甲氧基乙氧基乙基）胺）。也可使用碱金属，例如钠或钾。也可使用碱金属和碱土金属的氮化物和氢化物，例如氮化钠、氢化钠和氢化钙，以及碱金属的醇盐，例如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

[1241] 当实施本发明方法 (J) 时，反应温度可在相对较宽的范围内变化。一般而言，本方法在 0℃ 和 250℃ 之间、优选 50℃ 和 150℃ 之间的温度实施。

[1242] 本发明方法 (J) 通常在大气压力下实施。

[1243] 当实施本发明方法 (J) 时，式 (XIV) 的反应组分和脱质子碱通常以约等摩尔量使用。但是，也可使用相对较大程度过量（最多至 3mol）的一种或另一种组分。

[1244] 本发明方法 (K-α) 的特征在于式 (I-1-a)-(I-10-a) 的化合物各自与式 (XV) 的羰基卤化物反应，如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行。

[1245] 用于实施本发明方法 (K-α) 的适宜的稀释剂为所有对酰基卤呈惰性的溶剂。优选使用烃类，例如汽油、苯、甲苯、二甲苯和 1,2,3,4-四氢化萘，以及卤代烃类，例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、氯苯和邻二氯苯，以及酮类，例如丙酮和甲基异丙基酮，以及醚类，例如乙醚、四氢呋喃和二噁烷，还有羧酸酯类，例如乙酸乙酯，以及强极性溶剂，例如二甲基亚砷和环丁砷。酰基卤的水解稳定性使得该反应也可在水的存在下实施。

[1246] 用于本发明方法 (K-α) 的反应的适宜酸结合剂为所有常规的酸受体。优选使用叔胺，例如三乙胺、吡啶、二氮杂双环辛烷 (DABCO)、二氮杂双环十一碳烯 (DBU)、二氮杂双环壬烯 (DBN)、Hünig 碱和 N,N-二甲基苯胺，以及碱土金属氧化物，例如氧化镁和氧化钙，以及碱金属和碱土金属的碳酸盐，例如碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙，以及碱金属氢氧化物，例如氢氧化钠和氢氧化钾。

[1247] 本发明方法 (K-α) 中的反应温度可在相对较宽的范围内变化。一般而言，本方法在 -20℃ 和 +150℃ 之间、优选 0℃ 和 100℃ 之间的温度实施。

[1248] 当实施本发明方法 (K-α) 时，式 (I-1-a)-(I-10-a) 的原料和式 (XV) 的羰基卤化物通常各自以约相等的量施用。但是，也可使用相对较大程度过量（最多至 5mol）的羰基卤化物。通过常规方法进行后处理。

[1249] 本发明方法 (K-β) 的特征在于式 (I-1-a)-(I-10-a) 的化合物与式 (XVI) 的羧酸酐反应，如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行。

[1250] 适宜在本发明方法 (K-β) 中用作稀释剂的优选为使用酰基卤时同样优选的那些

稀释剂。此外,过量的羧酸酐也可同时用作稀释剂。

[1251] 如果需要,方法(K-β)中所添加的适宜的酸结合剂优选为使用酰基卤时同样优选的那些酸结合剂。

[1252] 本发明方法(K-β)中的反应温度可在相对较宽的范围内变化。一般而言,本方法在-20℃和+150℃之间、优选0℃和100℃之间的温度实施。

[1253] 当实施本发明方法(K-β)时,式(I-1-a)-(I-10-a)的原料和式(XVI)的羧酸酐通常各自以约相等的量施用。但是,也可使用相对较大程度过量(最多至5mol)的羧酸酐。通过常规方法进行后处理。

[1254] 一般而言,稀释剂和过量的羧酸酐及形成的羧酸通过蒸馏或者通过用一种有机溶剂或水洗涤而除去。

[1255] 本发明方法(L)的特征在于式(I-1-a)-(I-10-a)的化合物各自与式(XVII)的氯甲酸酯或氯甲酸硫代酯反应,如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行。

[1256] 用于本发明方法(L)的适宜的酸结合剂为所有常规的酸受体。优选使用叔胺,例如三乙胺、吡啶、DABCO、DBU、DBA、Hünig碱和N,N-二甲基苯胺,以及碱土金属氧化物,例如氧化镁和氧化钙,以及碱金属和碱土金属的碳酸盐,例如碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙,以及碱金属氢氧化物,例如氢氧化钠和氢氧化钾。

[1257] 用于本发明方法(L)中的适宜的稀释剂为所有对氯甲酸酯或氯甲酸硫代酯呈惰性的溶剂。优选使用烃类,例如汽油、苯、甲苯、二甲苯和1,2,3,4-四氢化萘,以及卤代烃类,例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、氯苯和邻二氯苯,以及酮类,例如丙酮和甲基异丙基酮,以及醚类,例如乙醚、四氢呋喃和二噁烷,以及羧酸酯类,例如乙酸乙酯,以及强极性溶剂,例如二甲基亚砷和环丁砷。

[1258] 当实施本发明方法(L)时,反应温度可在相对较宽的范围内变化。如果反应在一种稀释剂和一种酸结合剂的存在下进行,则反应温度通常在-20℃和+100℃之间、优选0℃和50℃之间。

[1259] 本发明方法(L)通常在大气压力下实施。

[1260] 当实施本发明方法(L)时,式(I-1-a)-(I-10-a)的原料和合适的式(XVII)的氯甲酸酯或氯甲酸硫代酯通常各自以约相等的量施用。但是,也可使用相对较大程度过量(最多至2mol)的一种或另一种组分。通过常规方法进行后处理。通常,除去沉淀的盐并在减压下通过除去稀释剂而浓缩剩余的反应混合物。

[1261] 本发明方法(M)的特征在于式(I-1-a)-(I-10-a)的化合物在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下各自与式(XVIII)的化合物反应。

[1262] 在制备方法(M)中,约1mol的式(XVIII)的氯单硫代甲酸酯或氯二硫代甲酸酯与每摩尔式(I-1-a)-(I-10-a)的原料在0-120℃、优选20-60℃反应。

[1263] 如果需要,添加的适宜的稀释剂为所有惰性的极性有机溶剂,例如醚、酰胺、砷、亚砷,以及卤代烷烃。

[1264] 优选使用二甲基亚砷、四氢呋喃、二甲基甲酰胺或二氯甲烷。

[1265] 在一个优选的实施方案中,如果化合物(I-1-a)-(I-10-a)的烯醇式盐通过添加强脱质子剂例如氢化钠或叔丁醇钾进行制备,则可免除另外添加酸结合剂。

[1266] 如果使用酸结合剂,则常规的无机或有机碱均适宜,例如氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、吡啶、三乙胺。

[1267] 该反应可在大气压力或提高的压力下进行,并且优选在大气压力下进行。通过常规方法进行后处理。

[1268] 本发明方法 (N) 的特征在于式 (I-1-a)-(I-10-a) 的化合物各自与式 (XIX) 的磺酰氯反应,如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行。

[1269] 在制备方法 (N) 中,约 1mol 的式 (XIX) 的磺酰氯与每摩尔式 (I-1-a)-(I-10-a) 的原料在 -20-150°C、优选 20-70°C 反应。

[1270] 如果需要,添加的适宜的稀释剂为所有惰性的极性有机溶剂,例如醚、酰胺、腈、砜、亚砜或卤代烃类,例如二氯甲烷。

[1271] 优选使用二甲基亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺、二氯甲烷。

[1272] 在一个优选的实施方案中,如果化合物 (I-1-a)-(I-10-a) 的烯醇式盐通过添加强脱质子剂(例如氢化钠或叔丁醇钾)进行制备,则可免除另外添加酸结合剂。

[1273] 如果使用酸结合剂,则常规的无机或有机碱均适宜,例如氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、吡啶、三乙胺。

[1274] 该反应可在大气压力或提高的压力下进行,并且优选在大气压力下进行。通过常规方法进行后处理。

[1275] 本发明方法 (O) 的特征在于式 (I-1-a)-(I-10-a) 的化合物各自与式 (XX) 的磷化合物反应,如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种酸结合剂的存在下进行。

[1276] 在制备方法 (O) 中,为获得式 (I-1-e)-(I-10-e) 的化合物,在 -40°C 和 150°C 之间、优选 -10 和 110°C 之间,每摩尔式 (I-1-a)-(I-10-a) 的化合物使用 1-2mol、优选 1-1.3mol 式 (XX) 的磷化合物。

[1277] 如果需要,添加的适宜的稀释剂为所有惰性的极性有机溶剂,例如醚、酰胺、腈、醇、硫化物、砜、亚砜等。

[1278] 优选使用乙腈、二甲基亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺、二氯甲烷。

[1279] 如果需要,添加的适宜的酸结合剂为常规的无机或有机碱,例如氢氧化物、碳酸盐或胺。可提及的实例有氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、吡啶、三乙胺。

[1280] 该反应可在大气压力或提高的压力下进行,并且优选在大气压力下进行。通过有机化学中的常规方法进行后处理。终产物优选通过结晶、色谱纯化或所谓的“初期蒸馏(incipient distillation)”——即在减压下除去挥发性组分——进行纯化而获得。

[1281] 方法 (P) 的特征在于式 (I-1-a)-(I-10-a) 的化合物与式 (XXI) 的金属氢氧化物或金属醇盐或者式 (XXII) 的胺反应,如果合适在一种稀释剂的存在下进行。

[1282] 适宜在本发明方法 (P) 中用作稀释剂的优选为醚,例如四氢呋喃、二噁烷、乙醚,或醇,例如甲醇、乙醇、异丙醇,以及水。

[1283] 本发明方法 (P) 通常在大气压力下进行。

[1284] 该反应温度一般在 -20°C 和 100°C 之间、优选 0°C 和 50°C 之间。

[1285] 本发明方法 (Q) 的特征在于式 (I-1-a)-(I-10-a) 的化合物各自 (Q- α) 与式 (XXIII) 的化合物反应,如果合适在一种稀释剂的存在下并且如果合适在一种催化剂的存在下进行;或者 (Q- β) 与式 (XXIV) 的化合物反应,如果合适在一种稀释剂的存在下并且如

果合适在一种酸结合剂的存在下进行。

[1286] 在制备方法 (Q- α) 中, 在 0-100°C、优选 20-50°C, 每摩尔式 (I-1-a)-(I-10-a) 的原料使用约 1mol 式 (XXIII) 的异氰酸酯。

[1287] 如果需要, 添加的适宜的稀释剂为所有惰性有机溶剂, 例如醚、酰胺、腈、砜、亚砜。

[1288] 如果合适, 可添加催化剂以加速反应。极有利地适于用作催化剂的为有机锡化合物, 例如二月桂酸二丁锡。该反应优选在大气压力下进行。

[1289] 在制备方法 (Q- β) 中, 在 -20-150°C、优选 0-70°C, 每摩尔式 (I-1-a)-(I-10-a) 的原料使用约 1mol 式 (XXIV) 的氨基甲酰氯。

[1290] 如果需要, 添加的适宜的稀释剂为所有惰性的极性有机溶剂, 例如醚、酰胺、砜、亚砜或卤代烃。

[1291] 优选使用二甲基亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺或二氯甲烷。

[1292] 在一个优选的实施方案中, 如果式 (I-1-a)-(I-10-a) 的烯醇式盐通过加入强脱质子剂 (例如, 氢化钠或叔丁醇钾) 进行制备, 则可免除另外添加酸结合剂。

[1293] 如果使用酸结合剂, 则常规的无机或有机碱均适宜, 例如氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、三乙胺或吡啶。

[1294] 该反应可在大气压力或提高的压力下进行, 并且优选在大气压力下进行。通过常规方法进行后处理。

[1295] 用于实施本发明方法 (R) 的适宜催化剂为钯 (0) 复合物。优选例如四 (三苯基膦) 钯。如果合适, 也可使用钯 (II) 化合物, 例如 PdCl_2 、 $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ 。如果使用钯 (II) 化合物, 则通常使用膦类, 例如三环己基膦作为复合物前体。

[1296] 用于实施本发明方法 (R) 的适宜的酸受体为无机或有机碱。这些优选包括碱土金属或碱金属氢氧化物、乙酸盐、碳酸盐或碳酸氢盐, 例如氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化钡或氢氧化铵、乙酸钠、乙酸钾、乙酸钙或乙酸铵、碳酸钠、碳酸钾、碳酸铯或碳酸铵、碳酸氢钠或碳酸氢钾; 碱金属氟化物, 例如氟化铯; 碱金属磷酸盐, 例如磷酸二氢钾; 以及叔胺, 例如三甲胺、三乙胺、三丁胺、N, N-二甲基苯胺、N, N-二甲基苄胺、吡啶、N-甲基哌啶、N-甲基吗啉、N, N-二甲基氨基吡啶、二氮杂双环辛烷 (DABCO)、二氮杂双环壬烯 (DBN) 或二氮杂双环十一碳烯 (DBU)。

[1297] 用于实施本发明方法 (R) 的适宜的稀释剂为水、有机溶剂及其任意混合物。可提及以下实例: 脂肪族、脂环族或芳香族的烃类, 例如石油醚、己烷、庚烷、环己烷、甲基环己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氢化萘; 卤代烃类, 例如氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷、三氯乙烷或四氯乙烯; 醚类, 例如乙醚、二异丙醚、甲基叔丁基醚、甲基叔戊基醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷、二乙二醇二甲醚或苯甲醚; 醇类, 例如甲醇、乙醇、正丙醇或异丙醇、正丁醇、异丁醇、仲丁醇或叔丁醇、乙二醇、1,2-丙二醇、乙氧基乙醇、甲氧基乙醇、二乙二醇一甲基醚; 水。

[1298] 在本发明方法 (R) 中, 反应温度可在相对宽的范围内变化。通常地, 该方法在 0°C 和 +140°C 之间、优选 50°C 和 100°C 之间的温度进行。

[1299] 当实施本发明方法 (R) 时, 式 (XXV) 的硼酸——其中 J 如上定义, 和式 (I-1')-(I-10') 的化合物——其中 A、B、D、G、m、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、X、Y 和 J' 如上定义, 以从 1:1 至 3:1、优选从 1:1 至 2:1 的摩尔比使用。通常每摩尔式 (I-1')-(I-10') 的化合

物使用 0.005-0.5mol、优选 0.01mol-0.1mol 催化剂。通常使用过量的碱。

[1300] 本发明的活性化合物 / 活性化合物结合物,具有良好的植物耐受性和对温血动物有利的毒性,并具有良好的环境耐受性,适于保护植物和植物器官、提高采收产率、改善采收物的质量和用于防治动物有害物,特别是农业、园艺、动物饲养、森林、园林和休闲设施、贮存产品和材料的保护及卫生领域中遇到的昆虫、蛛形纲动物、蠕虫、线虫和软体动物。它们可优选用作作物保护剂。它们对通常敏感的和抗性物种及所有或一些发育阶段具有活性。上述害虫包括:

[1301] 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.)。

[1302] 蛛形纲 (Arachnida), 例如, 粗脚粉螨 (*Acarus siro*)、柑橘瘤瘿螨 (*Aceria sheldoni*)、刺皮瘿螨属 (*Aculops* spp.)、针刺瘿螨属 (*Aculus*spp.)、花蜱属 (*Amblyomma* spp.)、锐缘蜱属 (*Argas* spp.)、牛蜱属 (*Boophilus* spp.)、短须螨属 (*Brevipalpus* spp.)、苜蓿苔螨 (*Bryobia praetiosa*)、皮螨属 (*Chorioptes* spp.)、鸡皮刺螨 (*Dermanyssus gallinae*)、始叶螨属 (*Eotetranychus* spp.)、梨上瘿螨 (*Epitrimerus pyri*)、真叶螨属 (*Eutetranychus* spp.)、瘿螨属 (*Eriophyes* spp.)、半跗线螨属 (*Hemitarsonemus* spp.)、璃眼蜱属 (*Hyalomma* spp.)、硬蜱属 (*Ixodes* spp.)、黑寡妇蜘蛛 (*Latrodectus mactans*)、*Metatetranychus*spp.、小爪螨属 (*Oligonychus* spp.)、钝缘蜱属 (*Ornithodoros* spp.)、全爪螨属 (*Panonychus* spp.)、桔芸锈螨 (*Phyllocoptruta oleivora*)、侧多食跗线螨 (*Polyphagotarsonemus latus*)、痒螨属 (*Psoroptes* spp.)、扇头蜱属 (*Rhipicephalus* spp.)、根螨属 (*Rhizoglyphus* spp.)、疥螨属 (*Sarcoptes* spp.)、中东金蝎 (*Scorpio maurus*)、*Stenotarsonemus* spp.、跗线螨属 (*Tarsonemus* spp.)、叶螨属 (*Tetranychus* spp.)、*Vasates lycopersici*。

[1303] Bivalva 纲, 例如, *Dreissena* spp.。

[1304] 唇足目 (Chilopoda), 例如, 地蜈蚣属 (*Geophilus* spp.)、*Scutigera*spp.。

[1305] 鞘翅目 (Coleoptera), 例如, 菜豆象 (*Acanthoscelides obtectus*)、喙丽金龟属 (*Adoretus* spp.)、杨树萤叶甲 (*Agelastic aalni*)、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.)、阿鳃金龟属 (*Apogonias*spp.)、*Atomaria* spp.、毛皮蠹属 (*Attagenus* spp.)、恶条豆象 (*Bruchidius obtectus*)、豆象属 (*Bruchus* spp.)、龟象属 (*Ceuthorhynchus* spp.)、*Cleonus mendicus*、宽胸叩头虫属 (*Conoderus*spp.)、根颈象属 (*Cosmopolites* spp.)、褐新西兰肋翅鳃角金龟 (*Costelytra zealandica*)、象虫属 (*Curculio* spp.)、杨干隐喙象 (*Cryptorhynchus lapathi*)、皮蠹属 (*Dermestes* spp.)、叶甲属 (*Diabrotica* spp.)、食植瓢虫属 (*Epilachna* spp.)、*Faustinus cubae*、裸蛛甲 (*Gibbium psylloides*)、黑异爪蔗金龟 (*Heteronychus arator*)、*Hylamorpha elegans*、北美家天牛 (*Hylotrupes bajulus*)、紫苜蓿叶象 (*Hypera postica*)、*Hypothenemus* spp.、甘蔗大褐齿爪鳃金龟 (*Lachnosterna consanguinea*)、马铃薯甲虫 (*Leptinotarsa decemlineata*)、稻根象 (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、筒喙象属 (*Lixus*spp.)、粉蠹属 (*Lyctus* spp.)、油菜花露尾甲 (*Meligethes aeneus*)、西方五月鳃角

金龟 (*Melolontha melolontha*)、*Migdolus* spp.、墨天牛属 (*Monochamus* spp.)、*Naupactus xanthographus*、黄蛛甲 (*Niptushololeucus*)、椰蛀犀金龟 (*Oryctes rhinoceros*)、锯谷盗 (*Oryzaephilus surinamensis*)、黑葡萄耳象 (*Otiorrhynchus sulcatus*)、小青花金龟 (*Oxycetonia jucunda*)、辣根猿叶虫 (*Phaedon cochleariae*)、食叶鳃金龟属 (*Phyllophaga* spp.)、日本弧丽金龟 (*Popillia japonica*)、*Premnotrypes* spp.、油菜金头跳甲 (*Psylliodes chrysocephala*)、蛛甲属 (*Ptinus* spp.)、暗色瓢虫 (*Rhizobius ventralis*)、谷蠹 (*Rhizopertha dominica*)、谷象属 (*Sitophilus* spp.)、尖隐喙象属 (*Sphenophorus* spp.)、茎干象属 (*Sternechus* spp.)、*Symphyletes* spp.、黄粉虫 (*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.)。

[1306] 弹尾目 (*Collembola*)，例如，武装棘跳虫 (*Onychiurus armatus*)。

[1307] 革翅目 (*Dermaptera*)，例如，欧洲球螋 (*Forficula auricularia*)。

[1308] 倍足目 (*Diplopoda*)，例如，*Blaniulus guttulatus*。

[1309] 双翅目 (*Diptera*)，例如，伊蚊属 (*Aedes* spp.)、按蚊属 (*Anopheles* spp.)、花园毛蚊 (*Bibio hortulanus*)、红头丽蝇 (*Calliphora erythrocephala*)、地中海蜡实蝇 (*Ceratitis capitata*)、金蝇属 (*Chrysomya* spp.)、锥蝇属 (*Cochliomyia* spp.)、*Cordylobia anthropophaga*、库蚊属 (*Culex* spp.)、黄蝇属 (*Cuterebra* spp.)、橄榄大实蝇 (*Dacus oleae*)、人肤蝇 (*Dermatobia hominis*)、果蝇属 (*Drosophila* spp.)、厕蝇属 (*Fannia* spp.)、胃蝇属 (*Gastrophilus* spp.)、黑蝇属 (*Hylemyia* spp.)、*Hyppobosca* spp.、皮蝇属 (*Hypoderma* spp.)、斑潜蝇属 (*Liriomyza* spp.)、绿蝇属 (*Lucilia* spp.)、家蝇属 (*Musca* spp.)、绿蝽属 (*Nezara* spp.)、狂蝇属 (*Oestrus* spp.)、瑞典麦秆蝇 (*Oscinella frit*)、藜泉蝇 (*Pegomya hyoscyami*)、草种蝇属 (*Phorbia* spp.)、螫蝇属 (*Stomoxys* spp.)、虻属 (*Tabanus* spp.)、*Tannia* spp.、欧洲大蚊 (*Tipula paludosa*)。

[1310] 腹足纲 (*Gastropoda*)，例如，*Arion* spp.、双脐螺属 (*Biomphalaria* spp.)、小泡螺属 (*Bulinus* spp.)、*Deroceras* spp.、土蜗属 (*Galba* spp.)、椎实螺属 (*Lymnaea* spp.)、钉螺属 (*Oncomelania* spp.)、琥珀螺属 (*Succinea* spp.)。

[1311] 蠕虫纲 (*Helminths*)，例如，十二指肠钩口线虫 (*Ancylostoma duodenale*)、斯里兰卡钩口线虫 (*Ancylostoma ceylanicum*)、巴西钩口线虫 (*Ancylostoma braziliensis*)、钩口线虫属 (*Ancylostoma* spp.)、似引蛔线虫 (*Ascaris lubricoides*)、蛔虫属 (*Ascaris* spp.)、马来布鲁线虫 (*Brugia malayi*)、帝汶布鲁线虫 (*Brugia timori*)、仰口线虫属 (*Bunostomum* spp.)、夏柏特线虫属 (*Chabertia* spp.)、枝睾吸虫属 (*Clonorchis* spp.)、古柏线虫属 (*Cooperia* spp.)、双腔吸虫属 (*Dicrocoelium* spp.)、丝状网尾线虫 (*Dictyocaulus filaria*)、阔节裂头绦虫 (*Diphyllobothrium latum*)、麦地那龙线虫 (*Dracunculus medinensis*)、细粒棘球绦虫 (*Echinococcus granulosus*)、多房棘球绦虫 (*Echinococcus multilocularis*)、蠕形住肠蛭虫 (*Enterobius vermicularis*)、*Faciola* spp.、血毛线虫属 (*Haemonchus* spp.)、异刺线虫属 (*Heterakis* spp.)、矮小啮壳绦虫 (*Hymenolepis nana*)、猪圆线虫属 (*Hyostromylus* spp.)、罗阿罗阿线虫 (*Loa loa*)、细颈线虫属 (*Nematodirus* spp.)、结节线虫属 (*Oesophagostomum* spp.)、后睾吸虫属 (*Opisthorchis* spp.)、旋盘尾丝虫 (*Onchocerca volvulus*)、奥斯脱线虫属

(*Ostertagia* spp.)、并殖吸虫属 (*Paragonimus* spp.)、*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 (*Trichinellanelsoni*)、*Trichinella pseudopsiralis*、毛圆线虫属 (*Trichostrongylus* spp.)、*Trichuris trichuria*、班氏吴策线虫 (*Wuchereria bancrofti*)。

[1312] 还可防治原生动物,例如艾美虫 (*Eimeria*)。

[1313] 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.)、*Campylommallivida*、异背长蝽属 (*Cavelerius* spp.)、臭虫属 (*Cimex* 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.)、*Heliopeltis* 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*)、绿蝽属、*Oebalus*spp.、*Pentomidae*、方背皮蝽 (*Piesma quadrata*)、壁蝽属 (*Piezodorus*spp.)、棉伪斑腿盲蝽 (*Psallus seriatus*)、*Pseudacysta perseae*、红猎蝽属 (*Rhodnius* spp.)、可可褐盲蝽 (*Sahlbergella singularis*)、黑蝽属 (*Scotinophora* spp.)、梨冠网蝽 (*Stephanitis nashi*)、*Tibraca* spp.、锥猎蝽属 (*Triatoma* spp.)。

[1314] 同翅目 (*Homoptera*),例如,无网长管蚜属 (*Acyrtosipon* spp.)、*Aeneolamia* spp.、隆脉木虱属 (*Agonosцена* spp.)、*Aleurodes* spp.、蔗粉虱属 (*Aleurolobus barodensis*)、*Aleurothrixus* spp.、芒果叶蝉属 (*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*)、*Bemisia* spp.、李短尾蚜 (*Brachycaudus helichrysi*)、*Brachycolus*spp.、甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*)、小褐稻虱 (*Calligypona marginata*)、*Carneocephala fulgida*、甘蔗粉角蚜 (*Ceratovacunalanigera*)、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*)、*Cocco-mytilus 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*、咖啡地粉蚧 (*Geococcus coffeae*)、假桃病毒叶蝉 (*Homalodisca coagulata*)、梅大尾蚜 (*Hyalopterus arundinis*)、吹绵蚧属 (*Icerya* spp.)、片角叶蝉属 (*Idiocerus* spp.)、扁喙叶蝉属 (*Idioscopus* spp.)、灰飞虱 (*Laodelphax striatellus*)、*Lecanium* spp.、蛎盾蚧属 (*Lepidosaphes* spp.)、萝

卜蚜 (*Lipaphis erysimi*)、长管蚜属 (*Macrosiphum* spp.)、*Mahanarva fimbriolata*、高粱蚜 (*Melanaphissacchari*)、*Metcalfiella* spp.、麦无网蚜 (*Metopolophium dirhodum*)、黑缘平翅斑蚜 (*Monellia costalis*)、*Monelliopsis pecanis*、瘤蚜属 (*Myzus* spp.)、莠苣衲长管蚜 (*Nasonovia ribisnigri*)、黑尾叶蝉属 (*Nephotettix* spp.)、褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*)、*Oncometopia* spp.、*Orthezia praelonga*、杨梅缘粉虱 (*Parabemisia myricae*)、*Paratriozaspp.*、片盾蚧属 (*Parlatoria* spp.)、瘿绵蚜属 (*Pemphigus* spp.)、玉米蜡蝉 (*Peregrinus maidis*)、绵粉蚧属 (*Phenacoccus* spp.)、杨平翅绵蚜 (*Phloeomyzus passerinii*)、忽布疣蚜 (*Phorodon humuli*)、*Phylloxera* spp.、苏铁褐点并盾蚧 (*Pinnaspis aspidistrae*)、臀纹粉蚧属 (*Planococcus* spp.)、梨形原绵蚧 (*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 (*Selenaspis articulatus*)、长唇基飞虱属 (*Sogata* spp.)、白背飞虱 (*Sogatella furcifera*)、*Sogatodes* spp.、*Stictocephala festina*、*Tenalaphara malayensis*、*Tinocalliscaryaefoliae*、广胸沫蝉属 (*Tomaspis* spp.)、声蚜属 (*Toxoptera* spp.)、温室粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*)、个木虱属 (*Trioza* spp.)、小叶蝉属 (*Typhlocyba* spp.)、尖盾蚧属 (*Unaspis* spp.)、*Viteus vitifolii*。

[1315] 膜翅目 (Hymenoptera)，例如，松叶蜂属 (*Diprion* spp.)、实叶蜂属 (*Hoplocampa* spp.)、毛蚁属 (*Lasius* spp.)、小家蚁 (*Monomorium pharaonis*)、胡蜂属 (*Vespa* spp.)。

[1316] 等足目 (Isopoda)，例如，鼠妇 (*Armadillidium vulgare*)、栉水虱 (*Oniscus asellus*)、球鼠妇 (*Porcellio scaber*)。

[1317] 等翅目 (Isoptera)，例如，散白蚁属 (*Reticulitermes* spp.)。

[1318] 鳞翅目 (Lepidoptera)，例如，桑剑纹夜蛾 (*Acronicta major*)、烦夜蛾 (*Aedia leucomelas*)、地老虎属 (*Agrotis* spp.)、棉叶波纹夜蛾 (*Alabama argillacea*)、干煞夜蛾属 (*Anticarsia* spp.)、*Barathra brassicae*、棉潜蛾 (*Bucculatrix thurberiella*)、松尺蠖 (*Bupalus piniarius*)、亚麻黄卷蛾 (*Cacoecia podana*)、*Capua reticulana*、苹果小卷蛾 (*Carpocapsa pomonella*)、冬尺蛾 (*Cheimatobia brumata*)、禾草螟属 (*Chilo* spp.)、枫色卷蛾 (*Choristoneura fumiferana*)、葡萄果蠹蛾 (*Clysia ambiguella*)、*Cnaphalocerus* spp.、埃及金刚钻 (*Earias insulana*)、地中海粉斑螟 (*Ephestia kuehniella*)、黄毒蛾 (*Euproctis chrysorrhoea*)、切根虫属 (*Euxoa* spp.)、脏切夜蛾属 (*Feltia* spp.)、大蜡螟 (*Galleria mellonella*)、*Helicoverpa* spp.、实夜蛾属 (*Heliothis* spp.)、褐织蛾 (*Hofmannophila pseudospretella*)、茶长卷蛾 (*Homonamagnanima*)、苹果巢蛾 (*Hyponomeuta padella*)、贪夜蛾属 (*Laphygma* spp.)、苹细蛾 (*Lithocolletis blancardella*)、绿果冬夜蛾 (*Lithophane antennata*)、豆白隆切根虫 (*Loxagrotis albicosta*)、毒蛾属 (*Lymantria* spp.)、黄褐天幕毛虫 (*Malacosoma neustria*)、甘蓝夜蛾 (*Mamestra brassicae*)、稻毛胫夜蛾 (*Mocis repanda*)、粘虫 (*Mythimna separata*)、*Oria* spp.、水稻负泥虫 (*Oulema oryzae*)、小眼夜蛾 (*Panolis flammea*)、红铃麦蛾

(*Pectinophora gossypiella*)、桔潜蛾 (*Phyllocnistiscitrella*)、菜粉蝶属 (*Pieris* spp.)、菜蛾 (*Plutella xylostella*)、斜纹夜蛾属 (*Prodenia* spp.)、*Pseudaletia* spp.、大豆夜蛾 (*Pseudoplusiaincludens*)、玉米螟 (*Pyrausta nubilalis*)、灰翅夜蛾属 (*Spodoptera*spp.)、*Thermesia gemmatilis*、袋谷蛾 (*Tinea pellionella*)、幕谷蛾 (*Tineola bisselliella*)、栎绿卷蛾 (*Tortrix viridana*)、粉夜蛾属 (*Trichoplusia* spp.)。

[1319] 直翅目 (Orthoptera), 例如, 家蟋 (*Acheta domesticus*)、东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*)、德国蠊 (*Blattella germanica*)、蝼蛄属 (*Gryllotalpa* spp.)、马德拉蜚蠊 (*Leucophaea maderae*)、飞蝗属 (*Locusta* spp.)、黑蝗属 (*Melanoplus* spp.)、美洲大蠊 (*Periplaneta americana*)、沙漠蝗 (*Schistocerca gregaria*)。

[1320] 蚤目 (Siphonaptera), 例如, 角叶蚤属 (*Ceratophyllus* spp.)、印鼠客蚤 (*Xenopsylla cheopis*)。

[1321] 综合目 (Symphyla), 例如, *Scutigera* *immaculata*。

[1322] 缨翅目 (Thysanoptera), 例如, 稻蓟马 (*Baliothrips biformis*)、*Enneothrips flavens*、花蓟马属 (*Frankliniella* spp.)、网蓟马属 (*Heliothrips* spp.)、温室条蓟马 (*Hercinothrips femoralis*)、葡萄蓟马 (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、硬蓟马属 (*Scirtothrips* spp.)、*Taeniothrips cardamoni*、蓟马属 (*Thrips* spp.)。

[1323] 缨尾目 (Thysanura), 例如, 衣鱼 (*Lepisma saccharina*)。

[1324] 植物寄生线虫包括, 例如, 滑刃线虫属 (*Aphelenchoides* spp.)、伞滑刃线虫属 (*Bursaphelenchus* spp.)、起绒草茎线虫 (*Ditylenchus dipsaci*)、球异皮线虫属 (*Globodera* spp.)、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.)。

[1325] 如果合适, 本发明化合物 / 活性化合物结合物也可以一定浓度或施用率用作除草剂、安全剂、生长调节剂或改善植物特性的药剂, 或用作杀微生物剂, 例如用作杀真菌剂、抗霉菌剂、杀细菌剂、杀病毒剂) 包括抵抗类病毒的药剂) 或用作抵抗 MLO) 支原体样微生物) 和 RLO) 立克次样微生物) 的药剂。如果合适, 它们也可被用作合成其他活性化合物的中间体或前体。

[1326] 所有的植物及植物部位均可依据本发明进行处理。本发明中植物的含义应理解为所有的植物及植物种群, 例如需要的及不需要的野生植物或作物植物) 包括天然存在的作物植物)。作物植物可为可通过常规植物育种和优选法或通过生物技术和遗传工程方法或通过前述方法的结合而获得的植物, 包括转基因植物和包括受植物种苗权保护或不受其保护的植物品种。植物部位的含义应理解为植物所有的地上及地下部位及植物器官, 例如芽、叶、花和根, 可提及的实例有叶、针叶、茎、干、花、子实体、果实、种子、根、块茎和根茎。植物部位还包括采收物, 及无性与有性繁殖物, 例如插枝、块茎、根茎、分枝和种子。

[1327] 根据本发明用活性化合物 / 活性化合物结合物对植物及植物部位进行的处理, 通过常规处理方法直接进行或使化合物作用于其环境、生境或贮存空间而进行, 所述常规处理方法例如浸液、喷雾、蒸发、弥雾、撒播、涂抹、注射, 并且, 对于繁殖物, 特别是对于种子,

还可施用一层或多层包衣。

[1328] 可将活性化合物 / 活性化合物结合物转化为常规制剂, 例如溶液剂、乳剂、可湿性粉剂、水基和油基悬浮剂、粉剂、粉末剂、膏剂、可溶性粉剂、可溶性颗粒剂、撒播颗粒剂、悬乳浓缩乳剂、经活性化合物浸渍的天然材料、经活性化合物浸渍的合成材料、肥料, 以及聚合物中的微胶囊剂。

[1329] 这些制剂以已知方式制备, 例如将活性化合物 / 活性化合物结合物与填充剂混合, 即, 与液体溶剂和 / 或固体载体混合, 任选使用表面活性剂, 即乳化剂和 / 或分散剂和 / 或发泡剂。

[1330] 如果所用填充剂为水, 还可使用例如有机溶剂作为助溶剂。适宜的液体溶剂主要有: 芳香族化合物, 例如二甲苯、甲苯或烷基苯; 氯代芳香族化合物和氯代脂族烃, 例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷; 脂族烃, 例如环己烷或石蜡, 如石油馏分、矿物油和植物油; 醇, 例如丁醇或乙二醇, 及其醚和酯; 酮, 例如丙酮、甲乙酮、甲基异丁基酮或环己酮; 强极性溶剂, 例如二甲基亚砷; 以及水。

[1331] 适宜的固体载体有:

[1332] 例如铵盐, 和粉碎的天然矿物如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、凹凸棒石、蒙脱石或硅藻土, 及粉碎的合成矿物如细分散的二氧化硅、氧化铝和硅酸盐; 适用于颗粒剂的固体载体有: 例如粉碎并分级的天然岩石, 例如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石; 及合成的无机及有机粉颗粒; 及有机物颗粒, 例如木屑、椰壳、玉米穗轴和烟草茎; 适宜的乳化剂和 / 或发泡剂有: 例如非离子及阴离子乳化剂, 例如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚, 如烷基芳基聚乙二醇醚, 烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐, 以及蛋白质水解产物; 适宜的分散剂有: 例如木素亚硫酸盐废液及甲基纤维素。

[1333] 制剂中可使用增粘剂, 例如羧甲基纤维素, 和粉末、颗粒或胶乳形式的天然及合成聚合物, 例如阿拉伯树胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯; 及天然磷脂, 例如脑磷脂和卵磷脂, 及合成磷脂。其他添加剂可为矿物油和植物油。

[1334] 可使用着色剂, 例如无机颜料, 如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝; 及有机染料, 例如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料; 及微量营养物质, 例如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐。

[1335] 制剂通常含有 0.1-95 重量%的活性化合物, 优选 0.5-90%之间。

[1336] 本发明的活性化合物 / 活性化合物结合物可以其市售制剂或者以将这些制剂与其他活性化合物混合所制备的使用形式而存在, 所述其他活性化合物例如杀昆虫剂、引诱剂、消毒剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、生长调节剂、除草剂、安全剂、肥料或化学信息素。

[1337] 特别有利的混合组分有例如以下化合物:

[1338] 杀真菌剂:

[1339] 核酸合成抑制剂

[1340] 苯霜灵 (benalaxyl)、精苯霜灵 (benalaxyl-M)、乙嘧酚磺酸酯 (bupirimate)、chiralaxyl、clozylacon、二甲嘧酚 (dimethirimol)、乙嘧酚 (ethirimol)、呋霜灵 (furalaxyl)、恶霉灵 (hymexazol)、甲霜灵 (metalaxyl)、高效霜灵 (metalaxyl-M)、呋酰胺 (ofurace)、噁霜灵 (oxadixyl)、啮菌酮 (oxolinic acid)

- [1341] 有丝分裂和细胞分裂抑制剂
- [1342] 苯菌灵 (benomyl)、多菌灵 (carbendazim)、乙霉威 (diethofencarb)、麦穗宁 (fuberidazole)、戊菌隆 (pencycuron)、噻菌灵 (thiabendazole)、甲基硫菌灵 (thiophanat-methyl)、苯酰菌胺 (zoxamide)
- [1343] 呼吸链复合物 I 的抑制剂
- [1344] 氟嘧菌胺 (diflumetorim)
- [1345] 呼吸链复合物 II 的抑制剂
- [1346] 啉酰菌胺 (boscalid)、萎锈灵 (carboxin)、甲呋酰胺 (fenfuram)、氟酰胺 (flutolanil)、呋吡菌胺 (furametpyr)、灭锈胺 (mepronil)、氧化萎锈灵 (oxycarboxin)、吡噻菌胺 (penthiopyrad)、溴氟唑菌 (thi-fluzamide)
- [1347] 呼吸链复合物 III 的抑制剂
- [1348] 嘧菌酯 (azoxystrobin)、氰霜唑 (cyazofamid)、醚菌胺 (dimoxystrobin)、enestrobin、噁唑菌酮 (famoxadone)、咪唑菌酮 (fenamidone)、氟嘧菌酯 (fluoxastrobin)、醚菌酯 (kresoxim-methyl)、苯氧菌胺 (metominostrobin)、肟醚菌胺 (orysastrobin)、唑菌胺酯 (pyraclostrobin)、啉氧菌酯 (picoxystrobin)、肟菌酯 (trifloxystrobin)
- [1349] 解偶剂
- [1350] 敌螨普 (dinocap)、氟啉胺 (fluazinam)
- [1351] ATP 产生抑制剂
- [1352] 三苯基乙酸锡 (fentin acetate)、三苯基氯化锡 (fentin chloride)、毒菌锡 (fentin hydroxide)、硅噻菌胺 (silthiofam)
- [1353] 氨基酸生物合成和蛋白质生物合成抑制剂
- [1354] 胺扑灭 (andoprim)、灭瘟素 (blasticidin-S)、嘧菌环胺 (cyprodinil)、春雷霉素 (kasugamycin)、春雷霉素一水合盐酸盐 (kasugamycin hydrochloride hydrate)、嘧菌胺 (mepanipyrim)、嘧霉胺 (pyrimethanil)
- [1355] 信号转导抑制剂
- [1356] 拌种咯 (fenpiclonil)、咯菌腈 (fludioxonil)、苯氧喹啉 (quinoxifen)
- [1357] 脂类和膜合成抑制剂
- [1358] 乙菌利 (chlozolate)、异菌脲 (iprodione)、腐霉利 (procymidone)、乙烯菌核利 (vinclozolin)
- [1359] 氨丙膦酸 (ampropylfos)、potassium-ampropylfos、敌瘟磷 (edifenphos)、异稻瘟净 (iprobenfos) (IBP)、稻瘟灵 (isoprothiolane)、吡菌磷 (pyrazophos)
- [1360] 甲基立枯磷 (tolclofos-methyl)、联苯
- [1361] iodocarb、霜霉威 (propamocarb)、霜霉威盐酸盐 (propamocarbhydrochloride)
- [1362] 麦角固醇生物合成抑制剂
- [1363] 环酰菌胺 (fenhexamid),
- [1364] 氧环唑 (azaconazole)、双苯三唑醇 (bitertanol)、糠菌唑 (bromuconazole)、环唑醇 (cyproconazole)、苄氯三唑醇 (diclobutrazole)、苯醚甲环唑 (difenoconazole)、烯唑醇 (diniconazole)、达克利 (diniconazole-M)、氟环唑 (epoxiconazole)、

乙环唑 (etaconazole)、腈苯唑 (fenbuconazole)、氟喹唑 (fluquinconazole)、氟硅唑 (flusilazole)、粉唑醇 (flutriafol)、呋菌唑 (furconazole)、呋醚唑 (furconazole-cis)、己唑醇 (hexaconazole)、亚胺唑 (imibenconazole)、种菌唑 (ipconazole)、叶菌唑 (metconazole)、腈菌唑 (myclobutanil)、多效唑 (paclobutrazol)、戊菌唑 (penconazole)、丙环唑 (propiconazole)、丙硫菌唑 (prothioconazole)、硅氟唑 (simeconazole)、戊唑醇 (tebuconazole)、四氟醚唑 (tetraconazole)、三唑酮 (triadimefon)、唑菌醇 (triadimenol)、灭菌唑 (triticonazole)、烯效唑 (uniconazole)、伏立康唑 (voriconazole)、抑霉唑 (imazalil)、烯菌灵 (imazalil sulphate)、恶咪唑 (oxpoconazole)、氯苯嘧啶醇 (fenarimol)、呋嘧啶醇 (flurprimidole)、氟苯嘧啶醇 (nuarimol)、啉斑肟 (pyrifenox)、噻氨灵 (triforine)、稻瘟酯 (pefurazoate)、咪鲜胺 (prochloraz)、氟菌唑 (triflumizole)、烯霜苄唑 (viniconazole),

[1365] aldimorph、十二环吗啉 (dodemorph)、十二环吗啉乙酸盐 (dodemorphacetate)、丁苯吗啉 (fenpropimorph)、十三吗啉 (tridemorph)、苯锈啉 (fenpropidin)、螺环菌胺 (spiroxamine),

[1366] 萘替芬 (naftifine)、稗草丹 (pyributicarb)、特比萘芬 (terbinafine)

[1367] 细胞壁合成抑制剂

[1368] 苯噻菌胺 (benthiavalicarb)、双丙氨膦 (bialaphos)、烯酰吗啉 (dimethomorph)、氟吗啉 (flumorph)、异丙菌胺 (iprovalicarb)、多抗霉素 (polyoxins)、多氧霉素 (polyoxorim)、有效霉素 A (validamycin A)

[1369] 黑色素生物合成抑制剂

[1370] 环丙酰菌胺 (capropamid)、双氯氰菌胺 (diclocymet)、氰菌胺 (fenoxanil)、四氯苯酞 (phthalid)、咯嗪酮 (pyroquilon)、三环唑 (tricyclazole)

[1371] 抗性诱导剂

[1372] 苯并噻二唑 (acibenzolar-S-methyl)、烯丙苯噻唑 (probenazole)、噻酰菌胺 (tiadinil)

[1373] 多位点化合物

[1374] 敌菌丹 (captan)、克菌丹、百菌清 (chlorothalonil)、铜盐例如:氢氧化铜、环烷酸铜、氯化铜 (copper oxychloride)、硫酸铜、氧化铜、喹啉铜 (oxine-copper) 和波尔多液、苯氟磺胺 (dichlofluanid)、二氰蒽醌 (dithianon)、多果定 (dodine)、多果定游离碱 (dodine freebase)、福美铁 (ferbam)、灭菌丹 (folpet)、氟灭菌丹 (fluorofolpet)、双胍辛盐 (guazatine)、双胍辛乙酸盐 (guazatine acetate)、双胍辛胺 (iminocadine)、双胍辛烷基苯磺酸盐 (iminocadine albesilate)、双胍辛胺乙酸盐 (iminocadine triacetate)、代森锰铜 (mancopper)、代森锰锌 (mancozeb)、代森锰 (maneb)、代森联 (metiram)、代森联锌 (metiram zinc)、丙森锌 (propineb)、硫和硫制剂包括多硫化钙、福美双 (thiram)、甲苯氟磺胺 (tolylfluanid)、代森锌 (zineb)、福美锌 (ziram)

[1375] 未知机理化合物

[1376] amibromdol、苯噻硫氰 (benthiazol)、bethoxazin、卡巴西霉素 (capsimycin)、香芹酮 (carvone)、灭螨猛 (chinomethionat)、氯化苦 (chloropicrin)、硫杂灵 (cufraneb)、

环氟菌胺 (cyflufenamid)、霜脍氰 (cymoxanil)、棉隆 (dazomet)、咪菌威 (debacarb)、哒菌酮 (diclomezine)、双氯酚 (dichlorophen)、氯硝胺 (dicloran)、野燕枯 (difenzoquat)、野燕枯甲基硫酸酯 (difenzoquat methyl sulphate)、二苯胺 (diphenylamine)、韩乐宁 (ethaboxam)、噁菌腈 (ferimzone)、氟酰菌胺 (flumetover)、磺菌胺 (flusulfamide)、氟啉酰菌胺 (fluopicolide)、氟氯菌核利 (fluoroimide)、六氯苯 (hexachlorobenzene)、8-羟基喹啉硫酸盐、人间霉素 (irumamycin)、磺菌威 (methasulphocarb)、苯菌酮 (metrafenone)、异硫氰酸甲酯 (methylisothiocyanate)、米多霉素 (mildiomycin)、多马霉素 (natamycin)、福美镍 (nickel dimethyl dithiocarbamate)、酞菌酯 (nitrothal-isopropyl)、辛噻酮 (octhilinone)、oxamocarb、oxyfenthin、五氯苯酚 (pentachlorophenol) 及其盐、2-苯基苯酚及其盐、病花灵 (piperalin)、propanosine-sodium、丙氧喹啉 (proquinazid)、硝吡咯菌素 (pyrrol nitrin)、五氯硝基苯 (quintozone)、叶枯酞 (tecloftalam)、四氯硝基苯 (tecnazene)、咪唑嗪 (triazoxide)、水杨菌胺 (trichlamide)、氰菌胺 (zarilamid) 及 2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺酰基)吡啶、N-(4-氯-2-硝基苯基)-N-乙基-4-甲基苯磺酰胺、2-氨基-4-甲基-N-苯基-5-噻唑甲酰胺、2-氯-N-(2,3-二氢-1,1,3-三甲基-1H-茚-4-基)-3-吡啶甲酰胺、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基异噁唑烷-3-基]吡啶、顺-1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)环庚醇、2,4-二氢-5-甲氧基-2-甲基-4-[[[1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]氨基]氧基]甲基]苯基]-3H-1,2,3-三唑-3-酮 (185336-79-2)、1-(2,3-二氢-2,2-二甲基-1H-茚-1-基)-1H-咪唑-5-羧酸甲酯、3,4,5-三氯-2,6-吡啶二腈、2-[[[环丙基[(4-甲氧基苯基)亚氨基]甲基]硫基]甲基]- α -(甲氧基亚甲基)苯乙酸甲酯、4-氯- α -丙炔氧基-N-[2-[3-甲氧基-4-(2-丙炔氧基)苯基]乙基]苯乙酰胺、(2S)-N-[2-[4-[3-(4-氯苯基)-2-丙炔基]氧基]-3-甲氧基苯基]乙基]-3-甲基-2-[(甲基磺酰基)氨基]丁酰胺、5-氯-7-(4-甲基哌啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶、5-氯-6-(2,4,6-三氟苯基)-N-[(1R)-1,2,2-三甲基丙基][1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-7-胺、5-氯-N-[(1R)-1,2-二甲基丙基]-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-7-胺、N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯烟酰胺、N-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)甲基-2,4-二氯烟酰胺、2-丁氧基-6-碘-3-丙基苯并吡喃-4-酮、N-{(Z)-[(环丙基甲氧基)亚氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苯乙酰胺、N-(3-乙基-3,5,5-三甲基环己基)-3-甲酰基氨基-2-羟基苯甲酰胺、2-[[[1-[3-(1-氟-2-苯基乙基)氧基]苯基]亚乙基]氨基]氧基]甲基]- α -(甲氧基亚氨基)-N-甲基- α -E-苯乙酰胺、N-{2-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]乙基}-2-(三氟甲基)苯甲酰胺、N-(3',4'-二氯-5-氟联苯基-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、N-(6-甲氧基-3-吡啶基)环丙烷甲酰胺、1-[(4-甲氧基苯氧基)甲基]-2,2-二甲基丙基-1H-咪唑-1-羧酸、0-[1-[(4-甲氧基苯氧基)甲基]-2,2-二甲基丙基]-1H-咪唑-1-硫代羧酸、2-(2-[[6-(3-氯-2-甲基苯氧基)-5-氟嘧啶-4-基]氧基]苯基)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺

[1377] 杀细菌剂：

[1378] 溴硝丙二醇 (bronopol)、双氯酚、三氯甲基吡啶 (nitrapyrin)、福美镍 (nickel dimethyldithiocarbamate)、春雷霉素、辛噻酮 (octhilinone)、羧酸呋喃

(furancarboxylic acid)、土霉素(oxytetracycline)、噻菌灵、链霉素(streptomycin)、叶枯酞、硫酸铜及其他铜制剂。

[1379] 杀昆虫剂 / 杀螨剂 / 杀线虫剂：

[1380] 乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂

[1381] 氨基甲酸酯类

[1382] 例如, 棉铃威(alanycarb)、涕灭威(aldicarb)、涕灭砒威(aldoxycarb)、除害威(allyxycarb)、灭害威(aminocarb)、噁虫威(bendiocarb)、丙硫克百威(benfuracarb)、必克虱(bufencarb)、畜虫威(butacarb)、丁酮威(butocarboxim)、丁酮砒威(butoxycarboxim)、甲萘威(carbaryl)、克百威(carbofuran)、丁硫克百威(carbosulphan)、除线威(cloethocarb)、敌蝇威(dimetilan)、乙硫苯威(ethiofencarb)、丁苯威(fenobucarb)、苯硫威(fenothiocarb)、伐虫脒(formetanate)、呋线威(furathiocarb)、异丙威(isoprocab)、威百亩(metam-sodium)、甲硫威(methiocarb)、灭多威(methomyl)、速灭威(metolcarb)、杀线威(oxamyl)、抗蚜威(pirimicarb)、猛杀威(promecarb)、残杀威(propoxur)、硫双威(thiodicarb)、久效威(thiofanox)、混杀威(trimethacarb)、XMC、灭杀威(xylylcarb)、啮蚜威(triazamate)

[1383] 有机磷酸酯类

[1384] 例如, 乙酰甲胺磷(acephate)、甲基吡恶磷(azamethiphos)、谷硫磷(azinphos-methyl)、乙基谷硫磷(azinphos-ethyl)、乙基溴硫磷(bromophos-ethyl)、溴苯烯磷(bromfenvinfos(-methyl))、特嘧硫磷(butathiofos)、硫线磷(cadusafos)、三硫磷(carbophenothion)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、毒虫畏(chlorfenvinphos)、氯甲硫磷(chlormephos)、甲基毒死蜱(chlorpyrifos-methyl)、乙基毒死蜱、蝇毒磷(coumaphos)、苯腈磷(cyanofenphos)、杀螟腈(cyanophos)、毒虫畏(chlorfenvinphos)、甲基内吸磷(demeton-S-methyl)、砒吸磷(demeton-S-methylsulphone)、氯亚胺硫磷(dialifos)、二嗪农(diazinon)、除线磷(dichlofenthion)、敌敌畏(dichlorvos/DDVP)、百治磷(dicrotophos)、乐果(dimethoate)、甲基毒虫畏(dimethylvinphos)、蔬果磷(dioxabenzofos)、乙拌磷(disulfoton)、苯硫磷(EPN)、乙硫磷(ethion)、灭线磷(ethoprophos)、乙嘧硫磷(etrifos)、伐灭磷(famphur)、苯线磷(fenamiphos)、杀螟硫磷(fenitrothion)、丰索磷(fensulfothion)、倍硫磷(fenthion)、吡氟硫磷(flupyrzofos)、地虫硫磷(fonofos)、安硫磷(formothion)、丁苯硫磷(fosmethilan)、噻唑磷(fosthiazate)、庚烯磷(heptenophos)、碘硫磷(iodofenphos)、异稻瘟净(iprobenfos)、氯唑磷(isazofos)、异柳磷(isofenphos)、O-水杨酸异丙酯、噁唑啉(isoxathion)、马拉硫磷(malathion)、灭蚜磷(mecarbam)、虫螨畏(methacrifos)、甲胺磷(methamidophos)、杀扑磷(methidathion)、速灭磷(mevinphos)、久效磷(monocrotophos)、二溴磷(naled)、氧化乐果(omethoate)、亚砒磷(oxydemeton-methyl)、甲基对硫磷(parathion methyl)、对硫磷(parathion-ethyl)、稻丰散(phenthoate)、甲拌磷(phorate)、伏杀硫磷(phosalone)、亚胺硫磷(phosmet)、磷胺(phosphamidon)、乙丙磷威(phosphocarb)、膈肟磷(phoxim)、虫螨磷(pirimiphos-methyl)、乙基虫螨磷(pirimiphos-ethyl)、丙溴磷(profenofos)、丙虫磷(propaphos)、胺丙畏(propetamphos)、丙硫磷(prothiofos)、发硫磷(prothoate)、吡唑硫磷(pyraclufos)、啞

嗒硫磷 (pyridaphenthion)、pyridathion、喹硫磷 (quinalphos)、硫线磷 (sebufos)、治螟磷 (sulphotep)、硫丙磷 (sulprofos)、丁基嘧啶磷 (tebupirimfos)、双硫磷 (temephos)、特丁硫磷 (terbufos)、杀虫畏 (tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷 (thiometon)、三唑磷 (triazophos)、敌百虫 (trichlorfon)、蚜灭磷 (vamidothion)

[1385] 钠通道调节剂 / 电压依赖性 (voltage-dependent) 钠通道阻断剂

[1386] 拟除虫菊酯类

[1387] 例如, 氟丙菊酯 (acrinathrin)、烯丙菊酯 (d-顺-反, d-反) (allethrin(d-cis-trans, d-trans))、高效氟氯氰菊酯 (beta-cyfluthrin)、联苯菊酯 (bifenthrin)、生物烯丙菊酯 (bioallethrin)、生物烯丙菊酯-S-环戊基异构体、bioethanomethrin、生物氯菊酯 (biopermethrin)、生物苄呋菊酯 (bioresmethrin)、chlovaporthrin、顺-氯氰菊酯、顺-苄呋菊酯 (cis-resmethrin)、顺-氯菊酯 (cis-permethrin)、功夫菊酯 (clocythrins)、乙氰菊酯 (cycloprothrin)、氟氯氰菊酯 (cyfluthrin)、氯氟氰菊酯 (cyhalothrin)、氯氰菊酯 (α -、 β -、 θ -、 ζ -) (cypermethrin(alpha-, beta-, theta-, zeta-))、苯醚氰菊酯 (cyphenothrin)、溴氰菊酯 (deltamethrin)、右旋烯炔菊酯 (1R 异构体) (empenthrin(1R isomer))、S-氰戊菊酯 (esfenvalerate)、醚菊酯 (etofenprox)、五氟苯菊酯 (fenfluthrin)、甲氰菊酯 (fenpropathrin)、吡氯氰菊酯 (fenpyrithrin)、氰戊菊酯 (fenvalerate)、溴氟菊酯 (flubrocycythrinate)、氟氰戊菊酯 (flucythrinate)、三氟醚菊酯 (flufenprox)、氟氯苯菊酯 (flumethrin)、氟胺氰菊酯 (fluvalinate)、fubfenprox、 γ -氯氟氰菊酯 (gamma-cyhalothrin)、咪炔菊酯 (imiprothrin)、噻噁菊酯 (kadethrin)、高效氯氟氰菊酯 (lambda-cyhalothrin)、甲氧苄氟菊酯 (metofluthrin)、氯菊酯 (顺-、反-)、苯醚菊酯 (1R-反式异构体) (phenothrin(1R-trans-isomer))、右旋炔丙菊酯 (prallethrin)、丙氟菊酯 (profluthrin)、protrifenbute、反灭虫菊 (pyresmethrin)、苄呋菊酯、噻噁菊酯 (RU-15525)、氟硅菊酯 (silaflofen)、氟胺氰菊酯 (tau-fluvalinate)、七氟菊酯 (tefluthrin)、环戊烯丙菊酯 (terallethrin)、胺菊酯 (1R 异构体) (tetramethrin(1R isomer))、四溴菊酯 (tralomethrin)、四氟苯菊酯 (transfluthrin)、溴氟菊酯 (ZXI 8901)、除虫菊素 (pyrethrins) (除虫菊 (pyrethrum))

[1388] DDT

[1389] 噁二嗪类 (oxadiazines)

[1390] 例如噁二唑虫 (indoxacarb)

[1391] 缩氨基脲类,

[1392] 例如 metaflumizone (BAS 3201)

[1393] 乙酰胆碱受体激动剂 / 拮抗剂

[1394] 氯烟碱基类 (chloronicotinyls),

[1395] 例如, 吡虫啉 (acetamiprid)、噻虫胺 (clothianidin)、呋虫胺 (dinotefuran)、吡虫啉 (imidacloprid)、烯啶虫胺 (nitenpyram)、硝虫噻唑 (nithiazine)、噻虫啉 (thiacloprid)、噻虫嗪 (thiamethoxam)

[1396] 烟碱 (nicotine)、杀虫磺 (bensultap)、巴丹 (cartap)

[1397] 乙酰胆碱受体调节剂

- [1398] 多杀霉素类 (spinosyns),
- [1399] 例如多杀菌素 (spinosad)
- [1400] GABA 门控性氯通道拮抗剂
- [1401] 有机氯类,
- [1402] 例如, 毒杀芬 (camphechlor)、氯丹 (chlordane)、硫丹 (endosulphan)、林丹 (gamma-HCH)、六六六 (HCH)、七氯 (heptachlor)、林丹 (lindane)、甲氧滴滴涕 (methoxychlor)
- [1403] fiprole 类,
- [1404] 例如, 乙酞虫腈 (acetoprole)、乙虫腈 (ethiprole)、氟虫腈 (fipronil)、pyrafluprole、pyriprole、氟吡唑虫 (vaniliprole)
- [1405] 氯通道激活剂类
- [1406] Mectin 类,
- [1407] 例如, 阿维菌素 (avermectin)、埃玛菌素 (emamectin)、埃玛菌素苯甲酸盐 (emamectin-benzoate)、齐墩螨素 (ivermectin)、米尔倍霉素 (milbemycin)
- [1408] 保幼激素模拟物 (mimetic) 类,
- [1409] 例如, 苯虫醚 (diofenolan)、保幼醚 (epofenonane)、苯氧威 (fenoxycarb)、烯虫乙酯 (hydroprene)、烯虫炔酯 (kinoprene)、烯虫酯 (methoprene)、吡丙醚 (pyriproxifen)、烯虫硫酯 (triprene)
- [1410] 蜕皮激素激动剂 / 干扰剂类,
- [1411] 二酰基肼类,
- [1412] 例如, 环虫酰肼 (chromafenozide)、氯虫酰肼 (halofenozide)、甲氧虫酰肼 (methoxyfenozide)、虫酰肼 (tebufenozide)
- [1413] 几丁质生物合成抑制剂类
- [1414] 苯甲酰脲类,
- [1415] 例如, 双三氟虫脲 (bistrifluron)、氟啶脲 (chlofluzuron)、除虫脲 (diflubenzuron)、啶蜚脲 (fluazuron)、氟环脲 (flucycloxuron)、氟虫脲 (flufenoxuron)、氟铃脲 (hexaflumuron)、虱螨脲 (lufenuron)、氟酰脲 (novaluron)、多氟脲 (noviflumuron)、氟幼脲 (penfluron)、氟苯脲 (teflubenzuron)、杀铃脲 (triflumuron)
- [1416] 噻嗪酮 (buprofezin)
- [1417] 灭蝇胺 (cyromazine)
- [1418] 氧化磷酸化抑制剂类, ATP 干扰剂类
- [1419] 丁醚脲 (diafenthiuron)
- [1420] 有机锡类,
- [1421] 例如三唑锡 (azocyclotin)、三环锡 (cyhexatin)、苯丁锡 (fenbutatin-oxide)
- [1422] 通过间断 H⁺ 质子梯度而起作用的氧化磷酸化去偶剂类
- [1423] 吡咯类,
- [1424] 例如虫螨腈 (chlorfenapyr)
- [1425] 二硝基酚类,
- [1426] 例如乐杀螨 (binapacyrl)、消螨通 (dinobuton)、敌螨普 (dinocap)、二硝甲酚

(DNOC)

- [1427] 位点 -I 电子转移抑制剂类
- [1428] METI 类,
- [1429] 例如喹螨醚 (fenazaquin)、唑螨酯 (fenpyroximate)、嘧螨醚 (pyrimidifen)、哒螨灵 (pyridaben)、吡螨胺 (tebufenpyrad)、唑虫酰胺 (tolfenpyrad)
- [1430] 伏蚁腴 (hydramethylnon)
- [1431] 三氯杀螨醇 (dicofol)
- [1432] 位点 -II 电子转移抑制剂类
- [1433] 鱼藤酮 (rotenone)
- [1434] 位点 -III 电子转移抑制剂类
- [1435] 灭螨醌 (acequinocyl)、嘧螨酯 (fluacrypyrim)
- [1436] 昆虫肠道膜微生物干扰剂类
- [1437] 苏云金杆菌 (*Bacillus thuringiensis*) 菌株
- [1438] 脂质合成抑制剂类
- [1439] 特窗酸类,
- [1440] 例如,螺螨酯 (spirodiclofen)、螺甲螨酯 (spiromesifen)
- [1441] 特特拉姆酸类 (tetramic acids),
- [1442] 例如, spirotetramate
- [1443] 甲酰胺类,
- [1444] 例如氟啶虫酰胺 (flonicamid)
- [1445] 章鱼胺能激动剂类,
- [1446] 例如虫螨脒 (amitraz)
- [1447] 镁刺激的 ATP 酶抑制剂类,
- [1448] 炔螨特 (propargite)
- [1449] 杀罗定 (ryanodine) 受体效应物类 (effectors),
- [1450] a) 苯甲酸二甲酰胺类 (benzoic acid dicarboxamides),
- [1451] 例如 flubenediamide
- [1452] b) 邻氨基苯甲酰胺类,
- [1453] 例如 rynaxapyr (3- 溴 -N-{4- 氯 -2- 甲基 -6-[(甲氨基) 羰基] 苯基 }-1-(3- 氯吡啶 -2- 基)-1H- 吡唑 -5- 甲酰胺)
- [1454] 沙蚕毒素类似物,
- [1455] 例如硫赐安 (thiocyclam hydrogen oxalate)、杀虫双 (thiosultap-sodium)
- [1456] 生物制剂类、激素类或信息素类
- [1457] 艾扎丁 (azadirachtin)、杆菌属种 (*Bacillus spec.*)、僵菌属种 (*Beauveria spec.*)、十二碳二烯醇 (codlemone)、绿僵菌属种 (*Metarrhizium spec.*)、拟青霉属种 (*Paecilomyces spec.*)、敌贝特 (thuringiensin)、轮枝菌属种 (*Verticillium spec.*)
- [1458] 具有未知或未确定作用机理的活性化合物类
- [1459] 熏蒸剂类,
- [1460] 例如,磷化铝、一溴甲烷、磺酰氟

- [1461] 拒食剂类，
- [1462] 例如，冰晶石、氟啉虫酰胺 (flonicamid)、吡蚜酮 (pymetrozine)
- [1463] 螨生长抑制剂类，
- [1464] 例如，四螨嗪 (clofentezine)、乙螨唑 (etoxazole)、噻螨酮 (hexythiazox)
- [1465] amidoflumet、benclothiaz、苯螨特 (benzoximate)、联苯肼酯 (bifenazate)、溴螨酯 (bromopropylate)、噻嗪酮 (buprofezin)、灭螨锰 (chinomethionat)、杀虫脒 (chlordimeform)、乙酯杀螨醇 (chlorobenzilate)、氯化苦 (chloropicrin)、clothiazoben、cycloprene、cyflumetofen、地昔尼尔 (dicyclanil)、fenoxacrim、氟硝二苯胺 (fentrifanil)、噻唑螨 (flubenzimine)、flufenerim、氟螨嗪 (flutenzin)、诱虫十六酯 (gossyplure)、伏蚁脔 (hydramethylnone)、japonilure、恶虫酮 (metoxadiazone)、石油、增效醚 (piperonyl butoxide)、油酸钾、啉虫丙醚 (pyridalyl)、氟虫胺 (sulfluramid)、三氯杀螨砜 (tetradifon)、杀螨硫醚 (tetrasul)、苯螨噻 (triarathene)、增效炔醚 (verbutin)
- [1466] 还可与其他已知活性化合物，例如除草剂、肥料、生长调节剂、安全剂、信息化学素相混合，或者与改善植物特性的试剂相混合。
- [1467] 当用作杀昆虫剂时，本发明的活性化合物 / 活性化合物结合物还可以其市售制剂的形式和由这些制剂与增效剂混合所制备的使用形式存在。增效剂为提高活性化合物的活性、而所添加的该增效剂本身不必具有活性的化合物。
- [1468] 当用作杀昆虫剂时，本发明的活性化合物 / 活性化合物结合物还可以其市售制剂的形式和由这些制剂与抑制剂混合所制备的使用形式存在，所述抑制剂可减少活性化合物用于植物的环境、植物表面部位或植物组织后的降解。
- [1469] 由市售制剂制备的使用形式的活性化合物含量可在较宽的范围内变化。使用形式的活性化合物浓度可为 0.00000001-95 重量%的活性化合物，优选 0.00001-1 重量%之间。
- [1470] 所述化合物以适合于使用形式的常规方式施用。
- [1471] 如上所述，可依据本发明处理所有的植物及其部位。在一个优选的实施方案中，处理了野生植物种和植物栽培种，或由常规生物育种方法例如杂交或原生质体融合而获得的植物品种和植物栽培种，以及它们的部位。在另一个优选的实施方案中，处理了由基因工程方法——如果合适，与常规方法相结合——而获得的转基因植物和植物栽培种（遗传修饰的生物体 (genetic modified organism)）及其部位。术语“部位”、“植物的部位”和“植物部位”解释如上。
- [1472] 特别优选依据本发明进行处理的植物为各自市售或使用的植物栽培种。植物栽培种的含义理解为由常规育种、诱变或重组 DNA 技术而获得的具有新特性（“特征”）的植物。它们可以是栽培种、生物型或基因型。
- [1473] 依据植物品种或植物变种、其种植地点和生长条件（土壤、气候、生长期、营养 (diet)），本发明的处理也可产生超加和（“协同”）效应。由此可取得如下超过实际预期的效果，例如降低本发明使用的物质和组合物的施用率和 / 或加宽其作用谱和 / 或提高其活性、改善植物生长、提高高温或低温耐受性、提高对于干旱或水或土壤含盐量的耐受性、提高开花品质、使采收更简易、加速成熟、提高采收产率、提高采收产品的质量和 / 或提高其营养价值、改善采收产品的贮存稳定性和 / 或其加工性能。

[1474] 优选依据本发明处理的转基因植物或植物栽培种（即通过遗传工程而获得的品种）包括通过基因修饰接受了遗传物质的所有植物，所述遗传物质赋予了所述植物特别有利的有用特征。所述特征的实例有改善植物生长、提高高温或低温耐受性、提高对干旱或水或土壤含盐量的耐受性、提高开花品质、使采收更简易、加速成熟、提高采收产率、提高采收产品的质量和/或提高其营养价值、改善采收产品的贮存稳定性和/或其加工性能。特别强调的所述特征的其他实例有改善植物对动物和微生物有害物的抵抗力，例如对昆虫、螨虫、植物致病真菌、细菌和/或病毒的抵抗力，以及提高植物对某些除草活性化合物的耐受性。可提及的转基因植物的实例为重要的作物植物，例如谷物（小麦、稻）、玉米、大豆、马铃薯、甜菜、西红柿、豌豆及其他蔬菜品种、棉花、烟草、油菜及果实植物（果实为苹果、梨、柑橘类水果及葡萄），并且特别强调的是玉米、大豆、马铃薯、棉花、烟草和油菜。特别强调的特征为通过在植物体内形成的毒素，特别是由苏云金杆菌的遗传物质（例如通过基因 Cry IA(a)、Cry IA(b)、Cry IA(c)、Cry IIA、Cry IIIA、Cry IIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb 和 Cry IF 及它们的结合）在植物体内形成的毒素，来提高植物对昆虫、蛛形纲动物、线虫和蛞蝓及蜗牛的抵抗力（以下简称为“Bt 植物”）。还特别强调的特征为通过系统获得性抗性 (SAR)、系统素、植物抗毒素、引发物 (elicitor) 和抗性基因以及相应的表达蛋白质和毒素来提高植物对真菌、细菌和病毒的抵抗力。此外特别强调的特征为提高植物对某些除草活性化合物的耐受性，例如对咪唑啉酮类、磺酰脲类、草甘磷 (glyphosate) 或草丁膦 (phosphinotricin) 的耐受性（例如“PAT”基因）。赋予所述所需特征的基因也可在转基因植物体内相互结合而存在。可提及的“Bt 植物”的实例有市售的商品名称为 YIELD GARD®（例如玉米、棉花、大豆）、KnockOut®（例如玉米）、StarLink®（例如玉米）、Bollgard®（棉花）、Nucoton®（棉花）和 NewLeaf®（马铃薯）的玉米品种、棉花品种、大豆品种和马铃薯品种。可提及的除草剂耐受性植物的实例有市售的商品名称为 Roundup Ready®（具有草甘磷耐受性，例如玉米、棉花、大豆）、Liberty Link®（具有草丁膦耐受性，例如油菜）、IMI®（具有咪唑啉酮耐受性）和 STS®（具有磺酰脲耐受性，例如玉米）的玉米品种、棉花品种和大豆品种。可提及的除草剂抗性植物（以常规的除草剂耐受性方式育种的植物）包括名称为 Clearfield®（例如玉米）的市售品种。当然，这些叙述也适用于具有所述基因特征或待开发基因特征的植物栽培种，所述植物栽培种将在未来进行开发和/或上市。

[1475] 所列植物可用本发明的通式 I 的化合物和/或本发明的活性化合物混合物以特别有利的方式依据本发明进行处理。上述活性化合物或混合物的优选范围也适用于处理所述植物。特别强调用本说明书中具体提及的化合物或混合物处理植物。

[1476] 本发明的活性化合物/活性化合物结合物不仅对植物害虫、卫生害虫和贮存产品害虫具有活性，而且对兽医领域中的动物寄生虫（体外寄生虫和体内寄生虫）例如硬蜱、软蜱、兽疥螨、叶螨、蝇（叮咬和吸食）、寄生蝇幼虫、虱、毛虱、羽虱和蚤也具有活性。所述寄生虫包括：

[1477] 虱目 (Anoplurida)，例如血虱属 (Haematopinus spp.)、毛虱属 (Linognathus spp.)、虱属 (Pediculus spp.)、Phtirus spp.、管虱属 (Solenopotes spp.)。

[1478] 食毛目 (Mallophagida) 和钝角亚目 (suborder Amblycerina) 及细角亚目 (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 (*Trichodectes* spp.)、猫羽虱属 (*Felicola* spp.)。

[1479] 双翅目及长角亚目 (suborder Nematocera) 和短角亚目 (*Brachycera*), 例如伊蚊属 (*Aedes* spp.)、按蚊属 (*Anopheles* spp.)、库蚊属 (*Culex* spp.)、蚋属 (*Simulium* spp.)、真蚋属 (*Eusimulium* spp.)、白蛉属 (*Phlebotomus* spp.)、罗蛉属 (*Lutzomyia* spp.)、库蠓属 (*Culicoides* spp.)、斑虻属 (*Chrysops* spp.)、瘤虻属 (*Hybomitra* spp.)、黄虻属 (*Atylotus* spp.)、虻属 (*Tabanus* spp.)、麻虻属 (*Haematopota* spp.)、*Philipomyia* spp.、蜂虻属 (*Braula* spp.)、家蝇属 (*Musca* spp.)、齿股蝇属 (*Hydrotaea* spp.)、螫蝇属 (*Stomoxys* spp.)、黑角蝇属 (*Haematobia* spp.)、莫蝇属 (*Morellia* spp.)、厕蝇属 (*Fannia* spp.)、舌蝇属 (*Glossina* spp.)、丽蝇属 (*Calliphora* spp.)、绿蝇属 (*Lucilia* spp.)、金蝇属 (*Chrysomya* spp.)、污蝇属 (*Wohlfahrtia* spp.)、麻蝇属 (*Sarcophaga* spp.)、狂蝇属 (*Oestrus* spp.)、皮蝇属 (*Hypoderma* spp.)、胃蝇属 (*Gasterophilus* spp.)、虱蝇属 (*Hippobosca* spp.)、羊虱蝇属 (*Lipoptena* spp.)、蜚蝇属 (*Melophagus* spp.)。

[1480] 蚤目 (*Siphonaptera*), 例如蚤属 (*Pulex* spp.)、栉首蚤属 (*Ctenocephalides* spp.)、客蚤属 (*Xenopsylla* spp.)、角叶蚤属 (*Ceratophyllus* spp.)。

[1481] 异翅目 (*Heteroptera*), 例如臭虫属 (*Cimex* spp.)、锥猎蝽属 (*Triatoma* spp.)、红猎蝽属 (*Rhodnius* spp.)、锥蝽属 (*Panstrongylus* spp.)。

[1482] 蜚蠊目 (*Blattaria*), 例如东方蜚蠊 (*Blattella orientalis*)、美洲大蠊、德国蠊 (*Blattella germanica*)、夏柏拉蟑螂属 (*Supella* spp.)。

[1483] 蜱螨亚纲 (*Acaria*, *Acarida*) 及后气门目 (*Metastigmata*) 和中气门目 (*Mesostigmata*), 例如锐缘蜱属 (*Argas* spp.)、钝缘蜱属 (*Ornithodoros* spp.)、残喙蜱属 (*Otobius* spp.)、硬蜱属 (*Ixodes* spp.)、花蜱属 (*Amblyomma* spp.)、牛蜱属 (*Boophilus* spp.)、革蜱属 (*Dermacentor* spp.)、*Haemophysalis* spp.、璃眼蜱属 (*Hyalomma* spp.)、扇头蜱属 (*Rhipicephalus* spp.)、皮刺螨属 (*Dermanyssus* spp.)、刺利螨属 (*Raillietia* spp.)、肺刺螨属 (*Pneumonyssus* spp.)、胸刺螨属 (*Sternostoma* spp.)、蜂螨属 (*Varroa* spp.)。

[1484] 轴螨目 (*Actiniedida*) (前气门亚目 (*Prostigmata*)) 和粉螨目 (*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 (*Ornithocheyletiella* spp.)、肉螨属 (*Myobia* spp.)、疮螨属 (*Psorergates* spp.)、蠕形螨属 (*Demodex* spp.)、恙螨属 (*Trombicula* spp.)、*Listrophorus* spp.、粉螨属 (*Acarus* spp.)、食酪螨属 (*Tyrophagus* spp.)、嗜木螨属 (*Caloglyphus* spp.)、颈下螨属 (*Hypodectes* spp.)、翅螨属 (*Pterolichus* spp.)、痒螨属 (*Psoroptes* spp.)、皮螨属 (*Chorioptes* spp.)、耳疥螨属 (*Otodectes* spp.)、疥螨属 (*Sarcoptes* spp.)、耳螨属 (*Notoedress* spp.)、疥螨属 (*Knemidocoptes* spp.)、气囊螨属 (*Cytodites* spp.)、鸡雏螨属 (*Laminosioptes* spp.)。

[1485] 本发明式 (I) 的活性化合物 / 活性化合物结合物也适用于防治侵袭农业生产性家畜的节肢动物, 所述农业生产性家畜, 例如牛、绵羊、山羊、马、猪、驴、骆驼、水牛、兔、家鸡、火鸡、鸭、鹅、蜜蜂, 其他宠物类, 例如狗、猫、笼鸟和观赏鱼, 以及所谓的试验性动物, 例如仓鼠、豚鼠、大鼠和小鼠。通过防治所述节肢动物, 将会减少死亡率和产量 (肉、奶、毛、皮、蛋、蜜等) 的降低, 从而通过使用本发明活性化合物可使畜牧更经济和更简便。

[1486] 本发明的活性化合物 / 活性化合物组合物以已知方式用于兽医领域和畜牧业中, 通过例如片剂、胶囊剂、饮剂、兽用顿服药、颗粒剂、膏剂、丸剂、喂服 (feed-through) 法和栓剂的方式进行肠内给药, 通过例如注射 (肌内、皮下、静脉内、腹膜内等)、植入进行肠胃外给药, 通过鼻部给药, 通过例如浸渍或沐浴 (bathing)、喷雾、浇注 (pouring on) 和点滴、清洗和撒粉的形式, 以及借助于含有活性化合物的模型制品例如颈圈、耳标、尾标、肢体缚带 (limb band)、笼头、标识器等进行皮肤给药。

[1487] 用于家畜、家禽、宠物等动物时, 式 (I) 的活性化合物可作为含有 1-80 重量%活性化合物的制剂 (例如粉剂、乳剂、可流动剂) 直接使用或稀释 100-10000 倍后使用, 或者它们可作为化学溶剂使用。

[1488] 此外已发现本发明的化合物 / 活性化合物组合物对毁坏工业材料的昆虫具有强的杀昆虫作用。

[1489] 以下昆虫可作为实例和优选——但不受任何限制——而提及:

[1490] 甲虫, 例如北美家天牛 (*Hylotrupes bajulus*)、*Chlorophorus pilosis*、家具窃蠹 (*Anobium punctatum*)、报死窃蠹 (*Xestobium rufovillosum*)、梳角细脉窃蠹 (*Ptilinus pecticornis*)、*Dendrobium pertinex*、松窃蠹 (*Ernobius mollis*)、*Priobium carpini*、褐粉蠹 (*Lyctus brunneus*)、非洲粉蠹 (*Lyctus africanus*)、南方粉蠹 (*Lyctus planicollis*)、栎粉蠹 (*Lyctus linearis*)、柔毛粉蠹 (*Lyctus pubescens*)、*Trogoxylon aequale*、鳞毛粉蠹 (*Minthes rugicollis*)、材小蠹种 (*Xyleborus spec.*)、*Tryptodendron spec.*、咖啡黑长蠹 (*Apatemonachus*)、榲长蠹 (*Bostry chuscapucins*)、褐异翅长蠹 (*Heterobostrychus brunneus*)、棘长蠹种 (*Sinoxylon spec.*)、竹长蠹 (*Dinoderus minutus*);

[1491] 膜翅目昆虫 (*Hymenopteron*), 例如大树蜂 (*Sirex juvencus*)、枞大树蜂 (*Urocerus gigas*)、泰加大树蜂 (*Urocerus gigas taignus*)、*Urocerus augur*;

[1492] 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 messanensis*)、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*);

[1493] 蠹虫 (*Bristletail*), 例如衣鱼 (*Lepisma saccharina*)。

[1494] 本说明书中工业材料的含义应理解为非活体 (non-living) 材料, 例如, 优选塑料、粘合剂、胶料、纸张和纸板、皮革、木材及木材制品和涂层组合物。

[1495] 极特别优选保护免受昆虫侵袭的材料为木材和木材制品。

[1496] 可受本发明组合物或含有所述组合物的混合物保护的木材和木材制品的含义应理解为, 例如:

[1497] 建筑木材、木梁、铁路枕木、桥梁构件、码头、木制交通工具、箱、货板、集装箱、电线杆、木质覆层 (wood cladding)、木制门窗、胶合板、刨花板、细木工制品, 或较常用于房屋建造或建筑木工的木材制品。

[1498] 活性化合物结合物可以浓缩剂或一般常规制剂的形式使用, 所述常规制剂例如, 粉剂、颗粒剂、溶液剂、悬浮剂、乳剂或膏剂。

[1499] 所述制剂可以本身已知的方式制备, 例如将活性化合物与至少一种溶剂或稀释

剂、乳化剂、分散剂和 / 或粘合剂或固定剂、防水剂混合,如 果需要还可与干燥剂及 UV 稳定剂混合,并且如果需要还可与着色剂和颜料以及其他加工助剂混合。

[1500] 用于保护木材和木质材料的杀昆虫的组合物或浓缩物含有 0.0001-95 重量%、特别是 0.001-60 重量%浓度的本发明的活性化合物。

[1501] 所用组合物或浓缩物的量取决于昆虫的种类和数量及介质。最佳施用量可分别通过一系列的施用试验而确定。但一般而言,以待保护的材料为基准,使用 0.0001-20 重量%、优选 0.001-10 重量%的活性化合物就已足够。

[1502] 所用溶剂和 / 或稀释剂为有机化学溶剂或溶剂混合物,和 / 或低挥发性的油性或油型有机化学溶剂或溶剂混合物,和 / 或极性有机化学溶剂或溶剂混合物,和 / 或水,并且如果合适,还有乳化剂和 / 或湿润剂。

[1503] 优选使用的有机化学溶剂为蒸发数大于 35 并且闪点大于 30℃、优选大于 45℃的油性或油型溶剂。具有低挥发性并且不溶于水的用作所述油性或油型溶剂的物质为适宜的矿物油或其芳香族馏分或含矿物油的溶剂混合物,优选石油溶剂、石油和 / 或烷基苯。

[1504] 有利地可使用的物质为 170-220℃沸程的矿物油、170-220℃沸程的石油溶剂、250-350℃沸程的锭子油、160-280℃沸程的石油和芳香族烃、松节油 (essence of turpentine) 等。

[1505] 在一个优选的实施方案中,使用 180-210℃沸程的液态脂肪烃,或 180-220℃沸程的芳香烃与脂肪烃的高沸点混合物,和 / 或锭子油,和 / 或一氯萘,优选 α -一氯萘。

[1506] 具有大于 35 的蒸发数并且大于 30℃、优选大于 45℃的闪点的低挥发性油性或油型有机溶剂,可以部分地用高挥发性或中等挥发性的有机化学溶剂替代,条件为该溶剂混合物也具有大于 35 的蒸发数并且大于 30℃、优选大于 45℃的闪点,并且杀昆虫 / 杀真菌混合物在该溶剂混合物中可溶或可乳化。

[1507] 在一个优选的实施方案中,有机化学溶剂或溶剂混合物或者脂肪族极性有机化学溶剂或溶剂混合物的一部分被替代。优选使用的物质为具有羟基和 / 或酯基和 / 或醚基的脂肪族有机化学溶剂,例如乙二醇醚、酯等。

[1508] 用于本发明范围的有机化学粘合剂为合成树脂,和 / 或可用水稀释和 / 或在施用的有机化学溶剂中可溶或可分散或可乳化的本身已知的粘合 性干性油,特别是由以下物质组成或含有以下物质的粘合剂:丙烯酸酯树脂、乙烯基树脂如聚乙酸乙烯酯、聚酯树脂、缩聚或加聚树脂、聚氨基甲酸乙酯树脂、醇酸树脂或改性醇酸树脂、酚树脂、烃类树脂例如茚 / 苯并呋喃树脂、硅酮树脂、基于天然树脂和 / 或合成树脂的干性植物油粘合剂和 / 或干性油粘合剂和 / 或物理干性粘合剂。

[1509] 用作粘合剂的合成树脂可以乳液、分散体或溶液形式使用。最高至 10 重量%的沥青或沥青类物质也可用作粘合剂。此外,可使用本身已知的着色剂、颜料、防水剂、除味剂 (odour-masking substance) 以及抑制剂或防腐剂等。

[1510] 根据本发明,组合物或浓缩物优选含有至少一种醇酸树脂或改性的醇酸树脂和 / 干性植物油作为有机化学粘合剂。本发明优选使用油含量超过 45 重量%、优选 50-68 重量%的醇酸树脂。

[1511] 全部的或部分的上述粘合剂可被固定剂 (混合物) 或增塑剂 (混合物) 替代。这些添加剂旨在防止活性化合物挥发及结晶或沉淀。所述添加剂优选替代 0.01-30% 的粘合

剂（以使用的粘合剂为 100% 计）。

[1512] 增塑剂源于以下化学类别：邻苯二甲酸酯，例如邻苯二甲酸二丁酯、邻苯二甲酸二辛酯或邻苯二甲酸苯甲基丁基酯；磷酸酯，例如磷酸三丁酯；己二酸酯，例如己二酸二（2-乙基己基）酯；硬脂酸酯，例如硬脂酸丁酯或硬脂酸戊酯；油酸酯，例如油酸丁酯；丙三醇醚或相对高分子量的乙二醇醚、丙三醇酯以及对甲苯磺酸酯。

[1513] 固定剂化学上基于聚乙烯基烷基醚，例如聚乙烯基甲基醚，或基于酮，例如二苯甲酮和亚乙基二苯甲酮。

[1514] 特别适宜作为溶剂或稀释剂的还有水，如果合适，所述水可与一种或多种上述有机化学溶剂或稀释剂、乳化剂及分散剂混合。

[1515] 特别有效的木材的保护通过大规模的工业浸渍工艺来完成，例如真空、双真空或加压工艺。

[1516] 如果合适，本发明的即用型组合物可还含有其他杀昆虫剂，并且如果合适可还含有一种或多种杀真菌剂。

[1517] 可提及的适宜的其他组分优选为 W094/29268 中提到的杀昆虫剂和杀真菌剂。该文献中提到的化合物表述为本申请的一部分。

[1518] 可进行掺合的极特别优选的组分为杀昆虫剂，例如毒死蜱 (chlorpyrifos)、腈肟磷、氟硅菊酯 (silaflofin)、顺式氯氰菊酯 (alphamethrin)、氟氯氰菊酯、氯氰菊酯 (cypermethrin)、溴氰菊酯、氯菊酯 (permethrin)、吡虫啉、啉虫脒 (NI-25)、氟虫脒、氟铃脒、四氟苯菊酯、噻虫啉、甲氧基酚盐 (methoxyphenoxid)、杀铃脒、chlothianidin、多杀菌素、七氟菊酯，

[1519] 和杀真菌剂，例如氧唑菌 (epoxyconazole)、己唑醇、氧环唑、丙环唑、戊唑醇、环唑醇、叶菌唑、抑霉唑、抑菌灵 (dichlorfluonid)、甲苯氟磺胺、3-碘-2-丙炔基丁基氨基甲酸酯、N-辛基-异噻唑啉-3-酮和 4,5-二氯-N-辛基异噻唑啉-3-酮。

[1520] 同时本发明化合物可用于保护与盐水或微咸水接触的目标物，特别是船体、筛、网、建筑物、系泊设备及信号系统，以防产生污垢。

[1521] 由固着性的寡毛纲 (Oligochaeta)，例如龙介虫科 (Serpulidae)，以及由贝壳 (shell) 及 Ledamorpha 种群（鹅茗荷 (goose barnacles)），例如各种茗荷属 (Lepas) 种及铠茗荷属 (Scalpellum) 种，或由藤壶 (Balanomorpha) 种群（藤壶 (acorn barnacles)），例如藤壶属 (Balanus) 种或龟足属 (Pollicipes) 种引起的污垢，会增加船只的摩擦阻力，结果由于更高的能量消耗和在干船坞上额外的频繁停靠导致运转成本显著增加。

[1522] 除由藻类，例如水云属 (Ectocarpus sp.) 和角藻属 (Ceramium sp.) 引起的污垢之外，由归入总称为蔓足纲 (Cirripedia)（甲壳纲的蔓足亚纲动物 (cirriped crustaceans)）的固着性 Entomostraka 群引起的污垢特别重要。

[1523] 令人惊奇地，现已发现本发明的化合物——单独的或与其他活性化合物结合，具有显著的防污活性。

[1524] 使用本发明的化合物——单独的或与其他活性化合物结合，可避免使用重金属，例如在以下化合物中使用的重金属：双（三烷基锡）硫化物、三正丁基月桂酸锡、三正丁基氯化锡、氧化亚铜 (I)、三乙基氯化锡、三正丁基-(2-苯基-4-氯苯氧基)锡、三丁基氧化锡、二硫化钼、氧化铈、钛酸丁酯聚合物、苯基（双吡啶）氯化铋、三正丁基氟化锡、亚

乙基二硫代氨基甲酸锰 (manganese ethylenebisthiocarbamate)、二甲基二硫代氨基甲酸锌、亚乙基二硫代氨基甲酸锌、2-吡啶硫醇-1-氧锌盐和 2-吡啶硫醇-1-氧铜盐、亚乙基二硫代氨基甲酸-双二甲基二硫代氨基甲酰锌 (bisdimethyldithiocarbamoylzinc ethylenebisthiocarbamate)、氧化 锌、亚乙基二硫代氨基甲酸亚铜 (I) (copper(I) ethylenebisdithiocarbamate)、硫氰酸铜、环烷酸铜和三丁锡卤化物,或显著降低上述化合物的浓度。

[1525] 如果合适,即用的防污涂料还可含有其他活性化合物,优选杀藻剂、杀真菌剂、除草剂、杀软体动物剂或其他防污活性化合物。

[1526] 优选与本发明防污组合物结合的适宜组分为:

[1527] 杀藻剂,例如,

[1528] 2-叔丁基氨基-4-环丙基氨基-6-甲硫基-1,3,5-三嗪、双氯酚、敌草隆 (diuron)、茵多酸 (endothal)、三苯基乙酸锡、异丙隆 (isoproturon)、甲基苯噻隆 (methabenzthiazuron)、乙氧氟草醚 (oxyfluorfen)、灭藻醌 (quinoclamine) 和特丁净 (terbutryn);

[1529] 杀真菌剂,例如,

[1530] 苯并 [b] 噻吩羧酸环己基酰胺-S, S-二氧化物、苯氟磺胺、fluorfolpet、3-碘-2-丙炔基丁基氨基甲酸酯、甲苯氟磺胺,和吡咯类例如:氧环唑、环唑醇、氧唑菌、己唑醇、叶菌唑、丙环唑和戊唑醇;

[1531] 杀软体动物剂,例如,

[1532] 三苯基乙酸锡、四聚乙醛 (metaldehyde)、甲硫威、杀螺胺 (niclosamid)、硫双威和混杀威、Fe 螯合物;

[1533] 或常规防污活性化合物,例如,

[1534] 4,5-二氯-2-辛基-4-异噻唑啉-3-酮、diiodomethylparatrylsulphone、2-(N, N-二甲基硫代氨基甲酰基硫)-5-硝基噻唑基,2-吡啶硫醇-1-氧钾盐、铜盐、钠盐和锌盐,吡啶-三苯基硼烷、四丁基二锡环氧乙烷 (tetrabutyl distannoxane), 2,3,5,6-四氯-4-(甲磺酰基)吡啶,2,4,5,6-四氯间苯二氰,二硫化四甲基秋兰姆和 2,4,6-三氯苯基马来酰亚胺。

[1535] 根据本发明的化合物发明,使用的防污组合物中含有 0.001-50 重量%、特别是 0.01-20 重量%浓度的活性化合物。

[1536] 此外,本发明的防污组合物还含有例如 Ungerer, Chem. Ind. 1985, 37, 730-732 和 Williams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973 中所述的常规组分。

[1537] 除本发明的杀藻、杀真菌、杀软体动物的活性化合物及杀昆虫的活性化合物之外,防污涂料还特别含有粘合剂。

[1538] 公认粘合剂的实例有:溶剂体系中的聚氯乙烯,溶剂体系中的氯化橡胶,溶剂体系特别是水体系中的丙烯酸树脂,水分散体形式或有机溶剂体系形式的氯乙烯/乙酸乙烯酯共聚物体系,丁二烯/苯乙烯/丙烯腈橡胶,干性油、例如亚麻子油,树脂酯或者与焦油或沥青、柏油和环氧化合物结合的改性硬树脂,少量氯化橡胶、氯化聚丙烯及乙烯基树脂。

[1539] 如果合适,涂料还包含优选不溶于盐水的无机颜料、有机颜料或着色剂。涂料还可含有使活性化合物控释的物质,例如松香。此外,涂料可含有增塑剂、影响流变特性的改性

剂及其他常规组分。本发明的化合物或上述混合物也可包含于自抛光防污体系中。

[1540] 本发明的活性化合物也适于防治封闭空间内发现的动物有害物,特别是昆虫、蛛形纲动物和螨虫,所述封闭空间例如住所、工厂车间、办公室、交通工具舱(vehicle cabin)等。它们可单独地或与其他活性化合物和助剂结合而用在防治这些害虫的家用杀虫产品中。它们对敏感物种和抗性物种以及全部发育阶段均具有活性。所述害虫包括:

[1541] 蝎目(Scorpionidea),例如地中海黄蝎(Buthus occitanus)。

[1542] 蜱螨目,例如波斯锐缘蜱(Argas persicus)、鸽锐缘蜱(Argasreflexus)、苔螨亚种(Bryobia ssp.)、鸡皮刺螨、家嗜甜螨(Glyciphagusdomesticus)、非洲钝缘蜱(Ornithodorus moubat)、血红扇头蜱(Rhipicephalus sanguineus)、阿氏真恙螨(Trombicula alfreddugesi)、Neutrombicula autumnalis、特嗜皮螨(Dermatophagoidespteronissimus)、法嗜皮螨(Dermatophagoides forinae)。

[1543] 蜘蛛目(Araneae),例如捕鸟蛛(Aviculariidae)、圆蛛(Araneidae)。

[1544] 盲蛛目(Opiliones),例如螯蝎(Pseudoscorpiones chelifer)、Pseudoscorpiones cheiridium、长跗盲蛛(Opiliones phalangium)。

[1545] 等足目,例如栉水虱、球鼠妇。

[1546] 倍足目,例如Blaniulus guttulatus、山蛰虫属(Polydesmus spp.)。

[1547] 唇足目,例如地蜈蚣属。

[1548] 衣鱼目(Zygentoma),例如栉衣鱼属(Ctenolepisma spp.)、衣鱼、盗火虫(Lepismodes inquilinus)。

[1549] 蜚蠊目,例如东方蜚蠊、德国蠊、亚洲蠊(Blattella asahinai)、马德拉蜚蠊、角腹蠊属(Panchlora spp.)、木蠊属(Parcoblatta spp.)、澳洲大蠊(Periplaneta australasiae)、美洲大蠊、大褐大蠊(Periplaneta brunnea)、烟色大蠊(Periplaneta fuliginosa)、棕带蜚蠊(Supella longipalpa)。

[1550] 跳跃目(Saltatoria),例如家蟋。

[1551] 革翅目,例如欧洲球螋。

[1552] 等翅目,例如木白蚁属(Kaloterms spp.)、散白蚁属。

[1553] 啮虫目(Psocoptera),例如Lepinatus spp.、粉啮虫属(Liposcelisspp.)。

[1554] 鞘翅目(Coleptera),例如圆皮蠹属、毛皮蠹属、皮蠹属、长头谷盗(Latheticus oryzae)、隐跗郭公虫属(Necrobia spp.)、蛛甲属、谷蠹、谷象(Sitophilus granarius)、米象(Sitophilus oryzae)、玉米象(Sitophilus zeamais)、药材甲(Stegobium paniceum)。

[1555] 双翅目,例如埃及伊蚊(Aedes aegypti)、白纹伊蚊(Aedesalbopictus)、带喙伊蚊(Aedes taeniorhynchus)、按蚊属、红头丽蝇、高额麻虻(Chrysozona pluvialis)、五带淡色库蚊(Culexquinquefasciatus)、尖音库蚊(Culex pipiens)、环喙库蚊(Culextarsalis)、果蝇属(Drosophila spp.)、夏厕蝇(Fannia canicularis)、家蝇(Musca domestica)、白蛉属、肉蝇(Sarcophaga carnaria)、蚋属、厩螯蝇(Stomoxys calcitrans)、欧洲大蚊。

[1556] 鳞翅目,例如小蜡螟(Achroia grisella)、大蜡螟、印度谷螟(Plodiainterpunctella)、木塞谷蛾(Tinea cloacella)、袋谷蛾、幕谷蛾。

[1557] 蚤目,例如犬栉首蚤(Ctenocephalides canis)、猫栉首蚤(Ctenocephalides

felis)、人蚤 (*Pulex irritans*)、穿皮潜蚤 (*Tungapenetrans*)、印鼠客蚤。

[1558] 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*)。

[1559] 虱目 (*Anoplura*), 例如头虱 (*Pediculus humanus capitis*)、体虱 (*Pediculus humanus corporis*)、阴虱 (*Phthirus pubis*)。

[1560] 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*)。

[1561] 它们单独地或与其他适宜的活性化合物结合用在家用杀昆虫剂领域中, 所述适宜的活性化合物例如磷酸酯类、氨基甲酸酯类、拟除虫菊酯类、新烟碱类、生长调节剂或其他已知杀昆虫剂类活性化合物。

[1562] 它们可以以下形式作为颗粒剂或粉末剂用于抛撒的饵料中或毒饵站 (bait station) 中: 气雾剂、无压喷雾产品, 例如泵喷雾和雾化器喷雾、自动雾化系统、雾化剂、泡沫剂、凝胶剂; 具有由纤维素或聚合物制得的蒸发片的蒸发产品, 液态蒸发剂、凝胶和膜蒸发剂, 推进器驱动的蒸发剂, 无动力或无源蒸发系统; 捕蛾纸、捕蛾袋和捕蛾胶。

[1563] 本发明的活性化合物 / 活性化合物结合物也可用作脱叶剂、干燥剂、除茎叶剂 (haulm killer), 特别是用作除杂草剂。广义的杂草的含义应理解为在不需要它们的地方生长的所有植物。本发明物质用作非选择性还是选择性除草剂, 主要取决于施用率。

[1564] 本发明的活性化合物 / 活性化合物结合物可用在例如以下植物中:

[1565] 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*、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*)。

[1566] 以下属的双子叶作物: 花生属 (*Arachis*)、甜菜属 (*Beta*)、芸苔属 (*Brassica*)、黄瓜属 (*Cucumis*)、南瓜属 (*Cucurbita*)、向日葵属 (*Helianthus*)、胡萝卜属 (*Daucus*)、大豆属 (*Glycine*)、棉属 (*Gossypium*)、番薯属 (*Ipomoea*)、莴苣属 (*Lactuca*)、亚麻属 (*Linum*)、番茄属 (*Lycopersicon*)、烟草属 (*Nicotiana*)、菜豆属 (*Phaseolus*)、豌豆属 (*Pisum*)、茄属 (*Solanum*)、蚕豆属 (*Vicia*)。

[1567] 以下属的单子叶杂草：山羊草属 (Aegilops)、冰草属 (Agropyron)、剪股颖属 (Agrostis)、看麦娘属 (Alopecurus)、Apera、燕麦属 (Avena)、臂形草属 (Brachiaria)、雀麦属 (Bromus)、蒺藜草属 (Cenchrus)、鸭跖草属 (Commelina)、狗牙根属 (Cynodon)、莎草属 (Cyperus)、龙爪茅属 (Dactyloctenium)、马唐属 (Digitaria)、稗属 (Echinochloa)、荸荠属 (Eleocharis)、蟋蟀草属 (Eleusine)、画眉草属 (Eragrostis)、野黍属 (Eriochloa)、羊茅属 (Festuca)、飘拂草属 (Fimbristylis)、异蕊花属 (Heteranthera)、白茅属 (Imperata)、鸭嘴草属 (Ischaemum)、千金子属 (Leptochloa)、黑麦草属 (Lolium)、雨久花属 (Monochoria)、黍属 (Panicum)、雀稗属 (Paspalum)、藜草属 (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)。

[1568] 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)。

[1569] 但是，本发明的活性化合物 / 活性化合物结合物的用途决不限于所述属，而是以相同方式扩展至其他植物。

[1570] 依据浓度，本发明的活性化合物 / 活性化合物结合物适于在例如工业地带和铁道以及有树和无树的道路和场所中用于非选择性地防治杂草。本发明活性化合物同样可用于防治多年生作物中的杂草，所述多年生作物例如森林、观赏性树木栽植、果园、葡萄园、柑桔林、坚果园、香蕉 种植园、咖啡种植园、茶叶种植园、橡胶种植园、油椰种植园、可可种植园、无核水果 (soft fruit) 种植园和蛇麻田 (hop field)、草坪、草地和牧场；和用于选择性防治一年生作物中的杂草。

[1571] 本发明的式 (I) 化合物 / 活性化合物结合物在用于土壤和地上植物部位时具有强的除草活性和较宽的作用谱。在某种程度上，它们也适于选择性防治单子叶和双子叶作物中的单子叶和双子叶杂草，出苗前和出苗后均可。

[1572] 本发明的活性化合物 / 活性化合物结合物也可以一定浓度或施用率用于防治动物有害物及真菌或细菌植物病害。如果合适，它们还可用作合成其他活性化合物的中间体或前体。

[1573] 可将本发明活性化合物 / 活性化合物结合物转化为常规制剂，例如溶液剂、乳剂、可湿性粉剂、悬浮剂、粉剂、粉末剂、膏剂、可溶性粉剂、颗粒剂、悬乳浓缩乳剂、经活性化合物浸渍的天然及合成材料，以及聚合物中的微胶囊。

[1574] 这些制剂以已知方式制备，例如通过将活性化合物与填充剂混合，即与液体溶剂和 / 或固体载体混合而制备，同时任选使用表面活性剂，即乳化剂和 / 或分散剂和 / 或发泡剂。

[1575] 如果所用填充剂为水，还可使用例如有机溶剂作为助溶剂。适宜的液体溶剂主要有：芳香族化合物，例如二甲苯、甲苯或烷基萘；氯化芳香族烃和氯化脂族烃，例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷；脂族烃，例如环己烷或石蜡，如石油馏分、矿物油和植物油；醇，例如丁醇或乙二醇，及其醚和酯；酮，例如丙酮、甲乙酮、甲基异丁基酮或环己酮；强极性溶剂，例如二甲基甲酰胺和二甲基亚砷；以及水。

[1576] 适宜的固体载体有：例如铵盐和粉碎的天然矿物，例如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、凹凸棒石、蒙脱石或硅藻土，以及粉碎的合成矿物，例如细分散二氧化硅、氧化铝和硅酸盐；适用于颗粒剂的固体载体有：例如粉碎并分级的天然岩石，如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石，以及合成的无机及有机粉颗粒，以及有机物颗粒例如锯木屑、椰壳、玉米穗轴和烟草茎；适宜的乳化剂和 / 或发泡剂有：例如非离子及阴离子的乳化剂，例如聚氧乙稀脂肪酸酯、聚氧乙稀脂肪醇醚，如烷基芳基聚乙二醇醚，烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐及蛋白质水解产物；适宜的分散剂有：例如木素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

[1577] 制剂中可使用增粘剂，例如羧甲基纤维素以及粉末、颗粒或胶乳形式的天然及合成聚合物，如阿拉伯树胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯，以及天然磷脂，例如脑磷脂和卵磷脂，以及合成磷脂。其他添加剂可以是矿物油和植物油。

[1578] 可使用着色剂，例如无机颜料，如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝，以及有机染料，例如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料，以及微量营养素如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐。

[1579] 制剂一般含有 0.1-95 重量%的活性化合物，优选 0.5-90%。

[1580] 本发明的活性化合物 / 活性化合物结合物本身或其制剂也可与已知除草剂和 / 或与改善作物植物耐受性的物质（“安全剂”）混合用于杂草防治目的，可即用混合或桶内混合（tank mix）。由此也可与含有一种或多种已知除草剂和一种安全剂的除草剂产品混合。

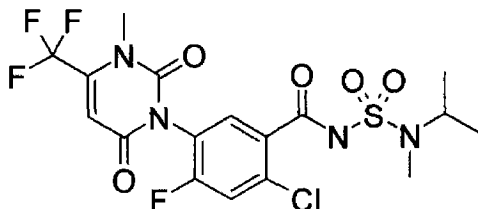
[1581] 适于混合的除草剂为已知除草剂，例如

[1582] 乙草胺 (acetochlor)、三氟羧草醚 (acifluorfen(-sodium))、苯草醚 (aclonifen)、甲草胺 (alachlor)、禾草灭 (alloxydim(-sodium))、莠灭净 (ametryne)、氨唑草酮 (amicarbazone)、先甲草胺 (amidochlor)、酰嘧磺隆 (amidosulfuron)、氨草啶 (aminopyralid)、莎稗磷 (anilofos)、磺草灵 (asulam)、莠去津 (atrazine)、唑啶草酮 (azafenidin)、四唑嘧磺隆 (azimsulfuron)、氟丁酰草胺 (bflubutamid)、草除灵 (benazolin(-ethyl))、呋草黄 (benfuresate)、苄嘧磺隆 (bensulfuron(-methyl))、灭草松 (bentazone)、bencarbazone、双苯嘧草酮 (benzfendizone)、双环磺草酮 (benzobicyclon)、吡草酮 (benzofenap)、新燕灵 (benzoylprop(-ethyl))、双丙氨膦 (bialaphos)、甲羧除草醚 (bifenox)、双草醚 (bispyribac(-sodium))、溴丁酰草胺 (bromobutide)、溴酚污 (bromofenoxim)、溴苯腈 (bromoxynil)、丁草胺 (butachlor)、氟丙嘧草酯 (butafenacil(-allyl))、丁苯草酮 (butoxydim)、丁草敌 (butylate)、唑草胺 (cafenstrole)、酰肼草 (caloxydim)、双酰草胺 (carbetamide)、唑草酯 (carfentrazone(-ethyl))、甲氧除草醚 (chlomethoxyfen)、草灭畏 (chloramben)、氯草敏 (chloridazon)、氯嘧磺隆 (chlorimuron(-ethyl))、草枯醚 (chlornitrofen)、氯磺隆 (chlorsulfuron)、绿麦隆 (chlortoluron)、吲哚酮草酯 (cinidon(-ethyl))、环庚草醚 (cinmethylin)、醚磺隆 (cinosulfuron)、环苯草酮 (clefoxydim)、烯草酮 (clethodim)、炔草酸 (clodinafop(-propargyl))、异恶草松 (clomazone)、氯甲酰草胺 (clomeprop)、二氯吡啶酸 (clopyralid)、clopyrasulfuron(-methyl)、氯酯磺草胺 (cloransulam(-methyl))、苄草隆、氰草津 (cyanazine)、cybutryne、环草敌 (cycloate)、环丙嘧磺隆 (cyclosulfamuron)、噻草酮 (cycloxydim)、氰氟草酯 (cyhalofop(-butyl))、2,4-D、2,4-DB、甜菜安 (desmedipham)、燕麦敌 (diallate)、麦草畏 (dicamba)、精 2,4-滴

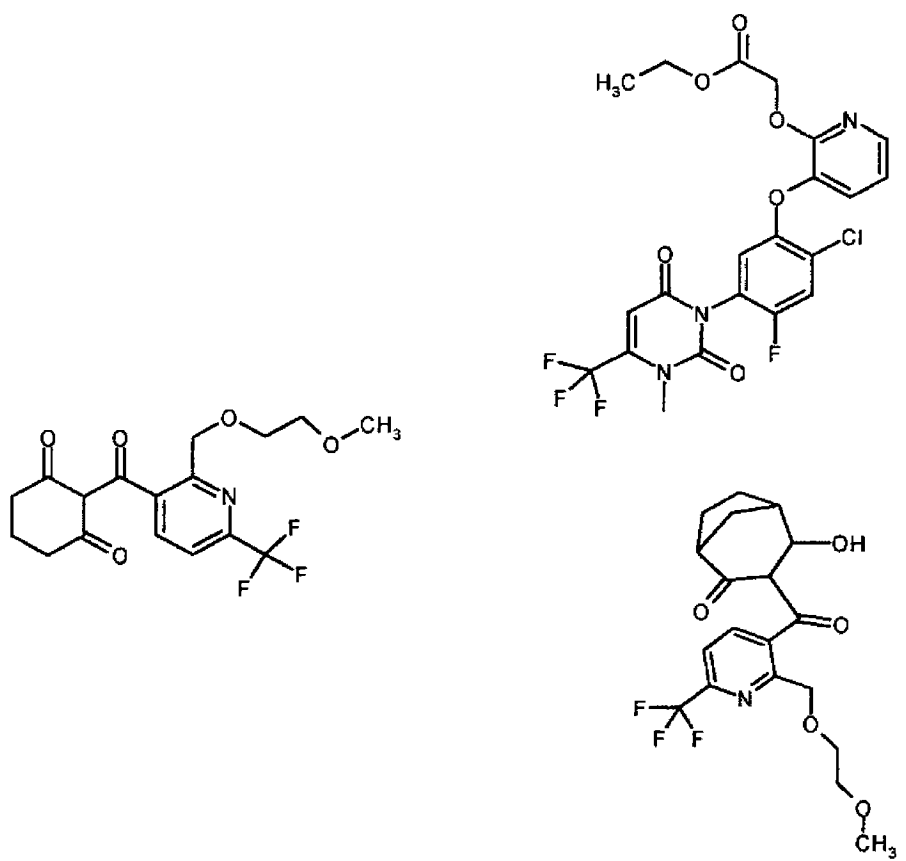
丙酸 (dichlorprop(-P))、禾草灵 (diclofop(-methyl))、双氯磺草胺 (diclosulam)、乙酰甲草胺 (diethatyl(-ethyl))、野燕枯 (difenzoquat)、吡氟酰草胺 (diflufenican)、氟吡草胺 (diflufenzopyr)、恶唑隆 (dimefuron)、哌草丹、二甲草胺 (dimethachlor)、异戊乙净 (dimethametryn)、二甲吩草胺 (dimethenamid)、dimexyflam、氨基灵 (dinitramine)、双苯酰草胺 (diphenamid)、敌草快 (diquat)、氟硫草定 (dithiopyr)、敌草隆 (diuron)、杀草隆、epropodan、EPTC、戊草丹 (esprocarb)、乙丁烯氟灵 (ethalfluralin)、胺苯磺隆 (ethametsulfuron(-methyl))、乙氧呋草黄 (ethofumesate)、氟乳醚 (ethoxyfen)、乙氧嘧磺隆 (ethoxysulfuron)、乙氧苯草胺 (etobenzanid)、精恶唑禾草灵 (fenoxaprop(-P-ethyl))、四唑酰草胺 (fentrazamide)、麦草氟 (异丙酯、异丙酯-L、甲酯) (flamprop(-isopropyl, -isopropyl-L, -methyl))、啶嘧磺隆 (flazasulfuron)、双氟磺草胺 (florasulam)、精吡氟禾草灵 (fluazifop(-P-butyl))、异丙吡草酯 (fluazolate)、氟酮磺隆 (flucarbazone(-sodium))、氟噻草胺 (flufenacet)、唑嘧磺草胺 (flumetsulam)、氟烯草酸 (flumiclorac(-pentyl))、丙炔氟草胺 (flumioxazin)、flumipropyn、唑嘧磺草胺 (flumetsulam)、氟草隆 (fluometuron)、氟咯草酮 (fluorochloridone)、乙羧氟草醚 (fluoroglycofen(-ethyl))、氟胺草唑 (flupoxam)、flupropacil、flurpysulfuron(-methyl, -sodium)、茚丁酯 (flurenol(-butyl))、氟啶草酮 (fluridone)、氯氟吡氧乙酸 (-丁氧基丙基, -meptyl) (fluroxypyr(-butoxypropyl, -meptyl))、呋嘧醇 (flurprimidol)、呋草酮 (flurtamone)、氟噻乙草酯 (fluthiacet(-methyl))、fluthiamide、氟磺胺草醚 (fomesafen)、甲酰氨磺隆 (foramsulfuron)、草铵膦 (glufosinate(-ammonium))、草甘膦异丙胺盐 (glyphosate(-isopropylammonium))、氟硝磺酰胺 (halosafen)、氟吡禾灵 (吡氟氯禾灵、精吡氟氯禾灵) (haloxyfop(-ethoxyethyl, -P-methyl))、环嗪酮 (hexazinone)、HOK-201、咪草酸 (imazamethabenz(-methyl))、imazamethapyr、氧咪草烟 (imazamox)、imazapic、咪唑烟酸 (imazapyr)、咪唑喹啉酸 (imazaquin)、咪唑乙烟酸 (imazethapyr)、唑吡嘧磺隆 (imazosulfuron)、碘甲磺隆钠盐 (iodosulfuron(-methyl, -sodium))、碘苯腈 (ioxynil)、异丙乐灵 (isopropalin)、异丙隆 (isoproturon)、异恶隆 (isouron)、异恶酰草胺 (isoxaben)、异恶氯草酮 (isoxachlortole)、异恶唑草酮 (isoxaflutole)、异恶草醚 (isoxapyrifop)、乳氟禾草灵 (lactofen)、环草定 (lenacil)、利谷隆 (linuron)、MCPA、2 甲 4 氯丙酸、苯噻酰草胺 (mefenacet)、甲基二磺隆 (mesosulfuron)、甲基磺草酮 (mesotrione)、恶唑酰草胺 (metamifop)、苯嗪草酮 (metamitron)、吡唑草胺 (metazachlor)、甲基苯噻隆 (methabenzthiazuron)、吡喃隆 (metobenzuron)、溴谷隆 (metobromuron)、 α -异丙甲草胺 ((α -)metolachlor)、磺草唑胺 (metosulam)、甲氧隆 (metoxuron)、嗪草酮 (metribuzin)、甲磺隆 (metsulfuron(-methyl))、禾草敌 (molinate)、绿谷隆 (monolinuron)、萘丙胺 (naproanilide)、敌草胺 (napropamide)、草不隆 (neburon)、烟嘧磺隆 (nicosulfuron)、氟草敏 (norflurazon)、坪草丹 (orbencarb)、嘧苯胺磺隆 (orthosulfamuron)、氨基乐灵 (oryzalin)、丙炔恶草酮 (oxadiargyl)、恶草酮 (oxadiazon)、环氧嘧磺隆 (oxasulfuron)、恶嗪草酮 (oxaziclomefone)、乙氧氟草醚 (oxyfluorfen)、百草枯 (paraquat)、壬酸 (pelargonic acid)、二甲戊灵 (pendimethalin)、pendralin、penoxsulam、环戊恶草酮 (pentoxazone)、甜菜宁 (phenmedipham)、氟吡酰草胺 (picolinafen)、pinoxaden、哌草磷 (piperophos)、丙草胺

(pretilachlor)、氟嘧磺隆 (primisulfuron(-methyl))、氟唑草胺 (profluazol)、扑草净 (prometryn)、毒草胺 (propachlor)、敌稗 (propanil)、恶草酸 (propaquizafop)、异丙草胺 (propisochlor)、propoxycarbazone(-sodium)、炔苯酰草胺 (propyzamide)、苄草丹 (prosulfocarb)、氟磺隆 (prosulfuron)、吡草醚 (pyraflufen(-ethyl))、pyrasulfotole、双唑草腈 (pyrazogyl)、吡唑特 (pyrazolate)、吡嘧磺隆 (pyrazosulfuron(-ethyl))、苄草唑 (pyrazoxyfen)、嘧啶肟草醚 (pyribenzoxim)、稗草丹 (pyributicarb)、吡草特 (pyridate)、pyridatol、环酯草醚 (pyriftalide)、嘧草醚 (pyriminobac(-methyl))、pyrimisulfan、嘧草硫醚 (pyrithiobac(-sodium))、pyroxsulam、pyroxasulfone、二氯喹啉酸 (quinchlorac)、氯甲喹啉酸 (quinmerac)、灭藻醌 (quinoclamine)、喹禾灵 (精喹禾灵、喹禾糖酯) (quizalofop(-P-ethyl, -P-tefuryl))、砒嘧磺隆 (rimsulfuron)、烯禾啉 (sethoxydim)、西玛津 (simazine)、西草净 (simetryn)、磺草酮 (sulcotrione)、甲磺草胺 (sulfentrazone)、甲嘧磺隆 (sulfometuron(-methyl))、草甘膦 (sulfosate)、磺酰磺隆 (sulfosulfuron)、牧草胺 (tebutam)、丁噻隆 (tebuthiuron)、tembotrione、tepraloxymdim、特丁津 (terbuthylazine)、特丁净 (terbutryn)、噻吩草胺 (thenylchlor)、thiafluamide、噻唑烟酸 (thiazopyr)、噻二唑草胺 (thidiazimin)、thiencarbazonemethyl、噻吩磺隆 (thifensulfuron(-methyl))、禾草丹 (thiobencarb)、仲草丹 (tiocarbazil)、topramezone、三甲苯草酮 (tralkoxydim)、野燕畏 (triallate)、醚苯磺隆 (triasulfuron)、苯磺隆 (tribenuron(-methyl))、三氯吡氧乙酸 (triclopyr)、灭草环 (tridiphane)、氟乐灵 (trifluralin)、三氟啶磺隆 (trifloxysulfuron)、氟胺磺隆 (triflusulfuron(-methyl))、三氟甲磺隆 (tritosulfuron) 和

[1583]



[1584]



[1585] 也可与其他已知活性化合物例如杀真菌剂、杀昆虫剂、杀螨虫剂、杀线虫剂、驱鸟剂、植物营养素及土壤改良剂混合。

[1586] 本发明的活性化合物 / 活性化合物结合物可以其本身、其制剂形式或由其通过进一步稀释而制备的使用形式，例如即用溶液、悬浮剂、乳剂、粉剂、膏剂和颗粒剂等形式施用。它们以常规方式施用，例如浇注、喷雾、雾化、抛撒 (spreading)。

[1587] 本发明的活性化合物 / 活性化合物结合物既可在植物出苗前也可在植物出苗后施用。还可将它们在种植前掺入土壤中。

[1588] 活性化合物的施用率可在非常宽的范围内变化，这主要取决于所需效果的性质。一般而言，施用率在 1g 至 10kg 活性化合物 / 公顷土壤面积之间，优选在 5g 至 5kg 活性化合物 / 公顷之间。

[1589] 本发明活性化合物结合物与作物植物相容性的有利效果在某些浓度比例时特别显著。但是，活性化合物结合物中各活性化合物的重量比可在相对宽泛的范围内变化。一般而言，每重量份式 (I) 活性化合物中存在 0.001-1000 重量份、优选 0.01-100 重量份、特别优选 0.05-20 重量份的一种上面提及的归于 (b') 的改进作物植物相容性 (解毒剂 / 安全剂) 的化合物。

[1590] 本发明的活性化合物结合物通常以制得的制剂的形式施用。但是，活性化合物结合物中所含的活性化合物可以单个的制剂施用，也可在使用过程中进行混合，即以桶内混合物的形式施用。

[1591] 对于某些施用，特别是通过出苗后方法进行施用，制剂中可更有利地包括植物相容性矿物油或植物油 (例如市售制剂 "Rako Binol")，或铵盐如硫酸铵或硫氰酸铵作为其他添加剂。

[1592] 本发明的新的活性化合物结合物可以其本身、其制剂形式或由所述制剂通过进一步稀释制得的使用形式使用,例如即用溶液剂、悬浮剂、乳剂、粉剂、膏剂和颗粒剂。可以通过常规方式施用,例如浇灌、喷雾、雾化、撒粉或撒播。

[1593] 本发明活性化合物结合物的施用率可在一定范围内变化;这尤其取决于气候及土壤因素。一般而言,施用率在 0.001 和 5kg/ha 之间,优选 0.005 和 2kg/ha 之间,特别优选 0.01 和 0.5kg/ha 之间。

[1594] 本发明的活性化合物结合物可在植物出苗前或其出苗后施用,即通过出苗前方法和出苗后方法施用。

[1595] 根据安全剂的特性,本发明所用安全剂可用于预处理作物植物的种子(拌种)或可播种前引入播种沟(seed furrow),或者在植物出苗前或其出苗后在除草剂之前单独使用或与除草剂一起使用。

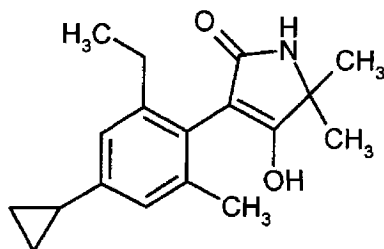
[1596] 可提及的植物的实例为重要的作物植物,例如谷类(小麦、大麦、稻)、玉米、大豆、马铃薯、棉花、油菜、甜菜、甘蔗以及果树(果实有苹果、梨、柑橘类水果及葡萄藤),特别强调谷类、玉米、大豆、马铃薯、棉花及油菜。

[1597] 术语“活性化合物”总是也包括本文提及的活性化合物结合物。

[1598] 制备实施例

[1599] 实施例 I-1-a-1

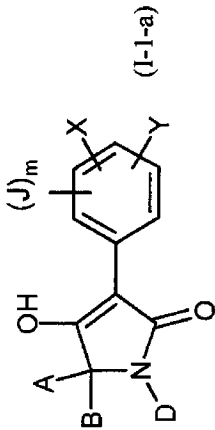
[1600]



[1601] 首先将 0.88g 叔丁醇钾引入 60℃ 的 10ml N,N-二甲基甲酰胺中,在 30min 的时间内逐滴加入溶解在 5ml N,N-二甲基甲酰胺中的 1g 实施例 II-1 的化合物,并将该混合物在 60℃ 搅拌 4h。将该混合物溶于 100ml 水中,用 1N HCl 调至 pH1,浓缩,再次溶于水中并浓缩。将剩余物溶于 10ml 水中并用二氯甲烷萃取,萃取液用硫酸钠干燥并浓缩。然后将剩余物在 4ml 乙酸乙酯中搅拌并用抽吸过滤。得到 0.3g 无色固体(理论产率的 36%),熔点 218℃。

[1602]

类似于实施例 (I-1-a-1) 并根据对制备过程的概述, 得到以下式 (I-a) 的化合物

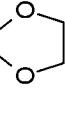


实施例序号	m	J	X	Y	D	A	B	熔点 °C	异构体
I-1-a-2	1	4-	2-C ₂ H ₅	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		222	β
I-1-a-3	1	4-	2-C ₂ H ₅	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		203	β
I-1-a-4	1	4-	2-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		264	β
I-1-a-5	1	2-	6-C ₂ H ₅	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	262	-
I-1-a-6	1	2-	6-C ₂ H ₅	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		245	β
I-1-a-7	1	2-	4-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		113	β
I-1-a-8	1	2-	4-CH ₃	6-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	100	-
I-1-a-9	1	2-	4-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		109	β

[1603]

实施例序号	m	J	X	Y	D	A	B	熔点 °C	异构体
I-1-a-10	1	 2-	6-Cl	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	*1.33 ppm (s, 6H, C(CH ₃) ₂), 0.75 (m, 2H, CH ₂ (环丙基)), 0.60 和 0.51 ppm (各自为 m, 1H, CH ₂ (环丙基))	-
I-1-a-11	1	 2-	6-Cl	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		*3.26 ppm (s, 3H, O-CH ₃), 0.75 (m, 2H, CH ₂ (环丙基)), 0.59 和 0.51 ppm (各自为 m, 1H, CH ₂ (环丙基))	β
I-1-a-12	1	 2-	6-Cl	4-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		*3.58 ppm (m, 2H, OCH ₂), 0.80 (m, 2H, CH ₂ (环丙基)), 0.67 和 0.53 ppm (各自为 m, 1H, CH ₂ (环丙基))	β
I-1-a-13	1	 4-	2-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -O-CH ₂) ₂ -		263	-

[1604]

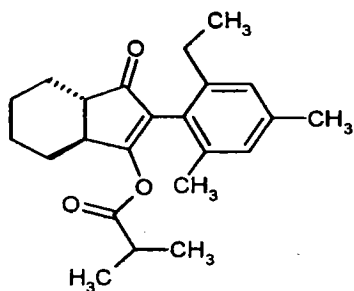
实施例序号	m	J	X	Y	D	A	B	熔点° C	异构体
I-1-a-14	1		6-Cl	4-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		*3.45 ppm (m, 2H, OCH ₂), 0.75 (m, 2H, CH ₂ (环丙基)), 0.59 和 0.51 ppm (各自为 m, 1H, CH ₂ (环丙基))	β
I-1-a-15	2		4-CH ₃	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		258-260	β
I-1-a-16	1		2-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -C-(CH ₂) ₂ - 		283	β
I-1-a-17	1		4-CH ₃	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		*3.55 ppm (m, 2H, OCH ₂), 0.75 (m, 2H, CH ₂ (环丙基)), 0.64 和 0.49 ppm (各自为 m, 1H, CH ₂ (环丙基))	β
I-1-a-18	1		6-C ₂ H ₅	4-CH ₃		-(CH ₂) ₃ -	H	224-226	-
I-1-a-19	2		4-CH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	248-250	-

[1605]

实施例序号	m	J	X	Y	D	A	B	熔点 ℃	异构体
I-1-a-20	1	 2-	6-CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		*3.41 ppm (s, 3H, O-CH ₃), 0.88 (m, 2H, CH ₂ (环丙基)), 0.72 和 0.51 ppm (各自为 m, 1H, CH ₂ (环丙基))	β
I-1-a-21	2	 2,4-	6-C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	CH ₃	216-219	-
I-1-a-22	2	 2,4-	6-C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		245-248	β
I-1-a-23	2	 2,6-	4-CH ₃	H	H		CH ₃	222-225	-
I-1-a-24	1	 4-	2-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		202-205	顺式
I-1-a-25	1	 4-	2-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		80-90	反式
I-1-a-26	1	 4-	2-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CH-(CH ₂) ₂ - CH ₂ OCH ₃		251	β

[1606] 实施例 I-1-b-1

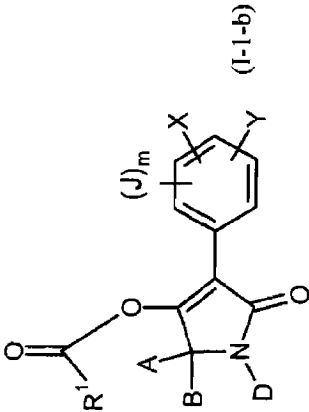
[1607]



[1608] 首先将 0.14g 实施例 I-1-a-5 的化合物引入 8ml 乙酸乙酯中,添加 0.05g 三乙胺和 1.5mg 4-N,N'-二甲基氨基吡啶,并将混合物加热至 60℃。在 60min 内分 7 份添加 0.05g 异丁基氯的 2ml 乙酸乙酯溶液,并将混合物在 60℃ 搅拌 6h。将混合物静置过夜,然后添加半浓缩的氯化钠溶液,并将有机相分离出,通过硅胶柱色谱法纯化(梯度从 EtOAc/正庚烷 1:9 至乙酸乙酯/正庚烷 100:0)。得到 90mg 无色固体(理论产率的 60%)。熔点:151℃。

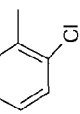
[1609]

类似于实施例 (I-1-b-1) 并根据对制备过程的概述，得到以下式 (I-1-b) 的化合物



实施例序号	m	J	X	Y	D	A	B	R ¹	熔点℃	异构体
I-1-b-2	1	4-	2-C ₂ H ₅	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		i-C ₃ H ₇	173	β
I-1-b-3	1	4-	2-C ₂ H ₅	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	*0.99(dd, 6H, CH(CH ₃) ₂) 2.18(s, 3H, Ar-CH ₃) 3.21(m, 1H, CHCH ₃)	β
I-1-b-4	1	4-	2-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	194-196	β
I-1-b-5	1	4-	2-CH ₃	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		i-C ₃ H ₇	199-202	β

[1610]

实施例序号	m	J	X	Y	D	A	B	R ¹	熔点℃	异构体
I-1-b-6	1	2 	6-C ₂ H ₅	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	190	B
I-1-b-7	2	2,6 	4-CH ₃	H	H		CH ₃	i-C ₃ H ₇	162-163	-
I-1-b-8	1	2 	4-CH ₃	6-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃		154-155	-
I-1-b-9	2	2,6 	4-CH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇	171	-
I-1-b-10	1	2 	4-CH ₃	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	*3.47 ppm (m, 2H, OCH ₂), 2.04 ppm (s, 3H, COCH ₃), 0.85 - 0.50 ppm (宽的多重峰, 4H, CH ₂ (环丙基))	B
I-1-b-11	2	2,6 	4-CH ₃	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	220-222	B
I-1-b-12	1	2 	6-Cl	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	186-187	B

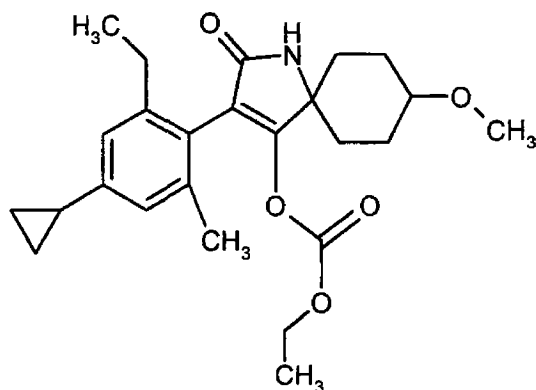
[1611]

实施例序号	m	J	X	Y	D	A	B	R ¹	熔点℃	异构体
I-1-b-13	2		6-CH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇	176-177	-
I-1-b-14	2		6-C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	190-192	B
I-1-b-15	1		6-C ₂ H ₅	4-CH ₃	-(CH ₂) ₃	H	H	i-C ₃ H ₇	* 4.75 ppm (m, 1H, CH-N (桥头)), 1.10 ppm (m, 9H, Ar-CH ₂)-CH ₃ -和 CH(CH ₃) ₂), 0.95 - 0.54 ppm (宽的 信号堆积峰, 4H, CH ₂ (环丙基))	-

*¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): ppm 计的位移 δ

[1612] 实施例 I-1-c-1

[1613]



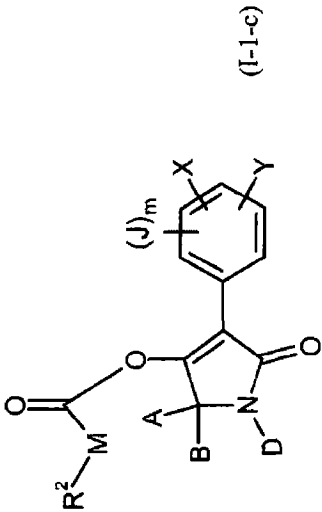
[1614] β 异构体

[1615] 首先将 0.15g 实施例 I-1-a-2 的化合物和 0.05g 三乙胺引入 8ml 二氯甲烷中,将混合物在 RT 搅拌 5min,添加 0.05g 氯甲酸乙酯,将混合物在 RT 搅拌过夜。添加 5ml 10% 浓度的 Na_2CO_3 溶液,将混合物在 RT 搅拌 10min,用萃取柱分离并用旋转蒸发仪浓缩,剩余物用 1/1 乙酸乙酯 / 正庚烷通过硅胶柱色谱法纯化。得到 68g 的一种油 (理论产率的 38%)。

[1616] $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) : δ = 2.18 (s, 3H; Ar- CH_3), 3.23 (m, 1H, CH_2OCH_3), 4.01 (q, 2H, OCH_2CH_3) ppm。

[1617]

类似于实施例 (I-1-c-1) 并根据对制备过程的概述, 得到以下式 (I-1-c) 的化合物



实施例序号	m	J	X	Y	D	A	B	M	R ²	熔点℃	异构体
I-1-c-2	1		2-C ₂ H ₅	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	*2.46(m,2H,Ar-CH ₂) 3.38(m,1H,CHO-CH ₂) 4.01(q,2H,O-CH ₂ -CH ₃)	β
I-1-c-3	1		2-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	200-202	β
I-1-c-4	1		2-CH ₃	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		O	C ₂ H ₅	190-192	β

[1618]

实施例序 号	m	J	X	Y	D	A	B	M	R ²	熔点℃	异构体
I-1-e-5	1	4- 	2-CH ₃	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	114-116	顺式
I-1-e-6	1	4- 	2-CH ₃	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	177	反式
I-1-e-7	1	2- 	4-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	*4.01 ppm (q, 2H, O-CH ₂), 3.38 ppm (s, 3H, OCH ₃), 0.83 0.75, 0.66, 0.56 ppm (各自为 m, 1H, CH ₂ (环丙基))	β
I-1-e-8	1	2- 	4-CH ₃	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		O	C ₂ H ₅	*4.01 ppm (q, 2H, O-CH ₂), 3.53 ppm (s, 2H, OCH ₂), 0.86 - 0.5 ppm (多个信号, 共 4H, CH ₂ (环 丙基))	β
I-1-e-9	1	2- 	6-Cl	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	199-202	β
I-1-e-10	1	2- 	4-CH ₃	6-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	O	C ₂ H ₅	*4.03 ppm (q, 2H, O-CH ₂), 1.51 ppm (s, 6H, C(CH ₃) ₂), 0.81 0.74, 0.64, 0.55 ppm (各自为 m, 1H, CH ₂ (环丙基))	-

[1619]

实施例序号	m	J	X	Y	D	A	B	M	R ²	熔点 °C	异构体
I-1-c-11	1	4 	2-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	210	-
I-1-c-12	1	2 	6-Cl	4-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		O	C ₂ H ₅	188-189	β
I-1-c-13	2	2,6 	4-CH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	O	C ₂ H ₅	*4.05 ppm (q, 2H, OCH ₂), 1.51 ppm (s, 6H, C(CH ₃) ₂), 0.79 ppm (m, 4H, CH ₂ (环丙基)), 0.70 和 0.59 ppm (各自为 m, 2H, CH ₂ (环丙基))	-
I-1-c-14	1	2 	4-CH ₃	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		O	C ₂ H ₅	236-237	β
I-1-c-15	1	2 	6-Cl	4-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		O	CH ₃	230-231	β
I-1-c-16	1	2 	4-CH ₃	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		O	C ₂ H ₅	173	β
I-1-c-17	1	2 	4-CH ₃	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		O	CH ₃	180-183	β
I-1-c-18	2	2,6 	4-CH ₃	H	H		CH ₃	O	C ₂ H ₅	155-156	-

[1620]

实施例序号	m	J	X	Y	D	A	B	M	R ²	熔点 ℃	异构体
I-1-c-19	2	2,6- 	4-CH ₃	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	205-208	β
I-1-c-20	1	2- 	4-Cl	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	176-177	β
I-1-c-21	2	2,4- 	6-C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	CH ₃	O	C ₂ H ₅	167-168	-
I-1-c-22	2	2,4- 	6-C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	*4.05 ppm (q, 2H, O-CH ₂), 3.40 ppm (s, 3H, O-CH ₃), 0.81 (m, 4H, CH ₂ (环丙基)), 0.67, 0.60 ppm (各自为 m, 2H, CH ₂ (环丙基))	β
I-1-c-23	2	2,4- 	6-C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	CH ₃	*3.63 ppm (s, 2H, COO-CH ₃), 3.40 ppm (s, 3H, O-CH ₃), 0.92 (m, 2H, CH ₂ (环丙基)), 0.82 - 0.55 ppm (宽的信号堆积峰, 6H, CH ₂ (环丙基))	β
I-1-c-24	1	2- 	6-C ₂ H ₅	4-CH ₃	- (CH ₂) ₃		H	O	C ₂ H ₅	*4.75 ppm (m, 1H, CH-N (桥头)), 4.19 ppm (dq, 2H, O-CH ₂), 0.95 - 0.54 ppm (宽的信号堆积峰, 4H, CH ₂ (环丙基))	-

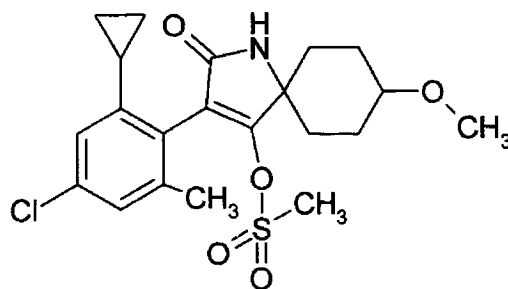
[1621]

实施例序号	m	J	X	Y	D	A	B	M	R ²	熔点℃	异构体
I-1-c-25	1		6-C ₃ H ₅	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	0	CH ₃	*3.63 ppm (s, 2H, O-CH ₂), 1.51 ppm (s, 6H, (CH ₃) ₂), 0.78 (m, 2H, CH ₂ (环丙基)), 0.67, 0.59 ppm (各自为 m, 1H, CH ₂ (环丙基))	-

*¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): ppm 计的 δ

[1622] 实施例 I-1-d-1

[1623]



[1624] β 异构体

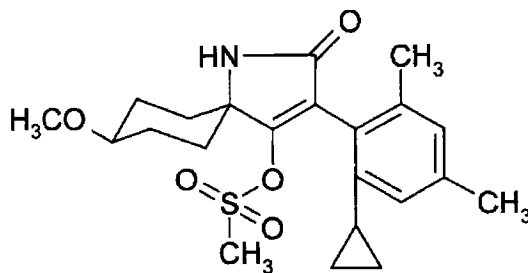
[1625] 首先将 0.15g (0.415mmol) 实施例 I-1-a-20 的化合物、0.07ml 三乙胺和 1.5mg DMAP 引入 10ml 氯仿中,将混合物在室温搅拌 10min,并添加 0.04ml 甲磺酰氯。将混合物在室温搅拌约 18h。反应结束后,将混合物倒入 5ml 5% 浓度的碳酸氢钠溶液中并在室温搅拌 10min。将有机相分离出并用 Na_2SO_4 干燥,用旋转蒸发仪在减压下除去溶剂。剩余物用柱色谱法纯化 (乙酸乙酯 / 正庚烷为 1:1)。

[1626] 产率 :0.082g (理论产率的 45%)。

[1627] $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) : δ = 0.67, 0.89ppm (2m, 各自为 2H, CH_2 -环丙基), 2.57ppm (s, 3H, $\text{SO}_2\text{-CH}_3$), 3.40ppm (s, 3H, O-CH_3)。

[1628] 类似于实施例 (I-1-d-1), 得到 实施例 (I-1-d-2) :

[1629]

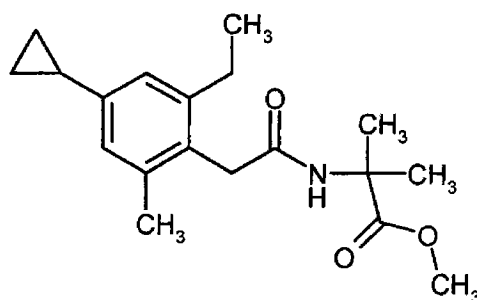


[1630] β 异构体

[1631] $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) : δ = 3.40ppm (s, 3H, O-CH_3), 2.47ppm (s, 3H, $\text{SO}_2\text{-CH}_3$), 0.87, 0.81, 0.67, 0.62ppm (各自为 m, 1H, CH_2 (环丙基))。

[1632] 实施例 II-1

[1633]



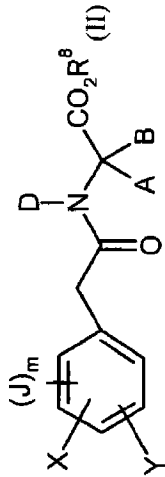
[1634] 将 1g 实施例 (XXX-2) 的化合物溶解在 30ml 二氯甲烷中,加入 2 滴 N, N- 二甲基甲酰胺和 0.76g 草酰氯,并将混合物在沸点加热回流 2h,直至不再放出气体,浓缩,分别用 20ml 二氯甲烷溶解两次,再次浓缩并溶于 20ml 二氯甲烷中 (溶液 1)。

[1635] 首先将 0.7g 1- 氨基异丁酸甲酯盐酸化物引入 30ml 二氯甲烷中,加入 0.97g 三乙胺,将混合物在室温搅拌 15min,然后在 30min 内逐滴加入溶液 1,将混合物在室温搅拌过

夜,加入 30ml 水,将混合物搅拌 20min 并将有机相分离出、干燥并用硅胶色谱法纯化(梯度从乙酸乙酯/庚烷为 5:95 至 100:0)。得到 1.05g 无色固体(理论产率的 72%)。熔点: 127°C。

[1636]

类似于实施例 (II-1) 并根据对制备过程的概述, 得到以下式 (II) 的化合物:



实施例序 号	m	J	X	Y	D	A	B	R ⁸	熔点℃	异构体
II-2	1	4-	2-C ₂ H ₅	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	123	β
II-3	1	4-	2-C ₂ H ₅	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	*2.89(m,1H, CHO CH ₂) 3.58(s,2H, Ar-CH ₂ -CO)	β
II-4	1	4-	2-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	*3.12(m,1H, CHO CH ₃) 6.80(s,2H,Ar-H)	β
II-5	1	2-	6-C ₂ H ₅	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	114	-
II-6	1	2-	6-C ₂ H ₅	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	96-98	β
II-7	1	2-	4-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	*3.12(m,1H, CHO CH ₃) 3.80(m,2H, Ar-CH ₂ -CO)	β
II-8	1	2-	4-CH ₃	6-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	*1.43(s,6H, C(CH ₃) ₂) 3.68(s,2H, Ar-CH ₂ -CO)	-

[1637]

实施例序 号	m	J	X	Y	D	A	B	R ⁸	熔点 ℃	异构体
II-9	1	2- 	4-CH ₃	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	*2.99(m, 1H, CH ₂ OC ₂ H ₅ -)	β
II-10	1	4- 	2-CH ₃	6-CH ₃		-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	131	β
II-11	1	4- 	2-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	189	-
II-12	1	4- 	2-CH ₃	6-CH ₃	H	CH₂-OCH₃ -(CH₂)₂-CH-(CH₂)₂-	CH ₃	156	β	
II-13	2	2,6- 	4-CH ₃	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	120	β
II-14	2	2,6- 	4-CH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	118-119	-
II-15	1	2- 	4-CH ₃	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	直接进一步反应	β
II-16	1	2- 	6-C ₂ H ₅	4-CH ₃		-(CH ₂) ₃ -	H	CH ₃	*4.52 ppm (m, 1H, CH-N), 0.85 (m, 2H, CH ₂ (环丙基)), 0.62 ppm (m, 2H, CH ₂ (环丙基))	-

[1638]

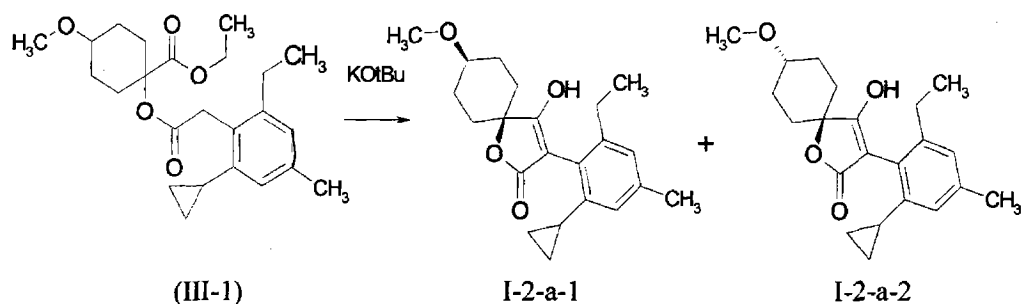
实施例序号	m	J	X	Y	D	A	B	R ⁸	熔点℃	异构体
II-17	1	4- 	2-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -C-(CH ₂) ₂ - 		CH ₃	174	-
II-18	1	2- 	4-Cl	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	129-131	β
II-19	1	2- 	6-Cl	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	122-123	-
II-20	1	2- 	6-Cl	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	129-131	β
II-21	1	2- 	6-Cl	4-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	100-101	β
II-22	1	2- 	6-Cl	4-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	* 3.68 ppm(s, 3H, OCH ₃), 3.41 ppm (m, 2H, OCH ₂), 0.99 和 0.66 (各自为 m, 2H, CH ₂ (环丙基))	β
II-23	2	2,4- 	6-C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	124-125	-
II-24	2	2,4- 	6-C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	-	β

[1639]

实施例序号	m	J	X	Y	D	A	B	R ⁸	熔点℃	异构体
II-25	2		4-CH ₃	H	H		CH ₃	CH ₃	*3.70 ppm (s, 3H, COO-CH ₃), 1.37 ppm (s, 3H, CH ₃), 1.89 ppm (m, 2H, Ar-CH (环丙基))	-
II-26	2		6-CH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	*1.42 ppm (s, 6H, (CH ₃) ₂ C-NH), 3.80 ppm (s, 2H, Ar-CH ₂ -CO)	-
II-27	1		4-CH ₃	6-CH ₃	-(CH ₂) ₃ -		H	CH ₃	*4.18 ppm (m, 2H, O-CH ₂), 3.95 和 3.81 ppm (各自为 m, 共 1H, CH-O), 0.94 和 0.67 (各自为 m, 2H, CH ₂ (环丙基))	-

*¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): 以 ppm 计的位移 δ

[1640]



[1641] 首先将 0.59g(1.466mmol) 实施例 (III-1) 的化合物引入 10ml DMF 中, 添加 0.247g(2.199mmol) 叔丁醇钾, 并将混合物在室温下搅拌 12h。用旋转蒸发仪除去 DMF, 剩余物在水和甲基叔丁基醚之间分配, 水相用盐酸酸化, 用二氯甲烷萃取产物, 并将有机相进行干燥并用旋转蒸发仪浓缩。

[1642] 进一步纯化和分离异构体, 将 0.37g 粗产物用硅胶柱 RP18 进行层析 (乙腈/水)。

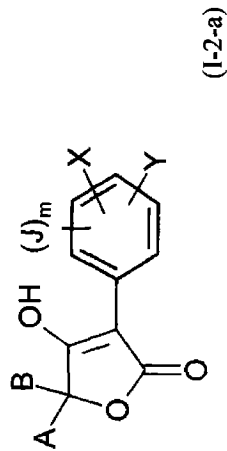
[1643] 产率:

[1644] 89mg I-2-a-1 (理论产率的 17%), $\log P = 2.81$

[1645] 132mg I-2-a-2 (理论产率的 25%), $\log P = 3.07$

[1646]

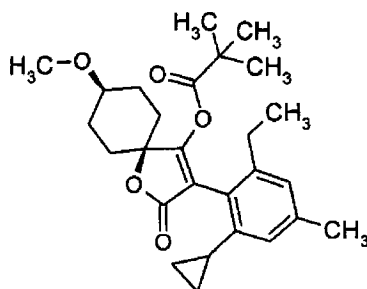
类似于实施例 (I-2-a-1) 和 (I-2-a-2) 并根据对制备过程的概述，得到以下式 (I-2-a) 的化合物：



实施例序号	m	J	X	Y	A	B	logP	异构体
I-2-a-3	1	4-	2-CH ₃	6-CH ₃	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		2.64	顺式
I-2-a-4	1	4-	2-CH ₃	6-CH ₃	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		2.88	反式
I-2-a-5	1	4-	2-CH ₃	6-CH ₃	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		2.36	-

[1647] 实施例 I-2-b-1

[1648]

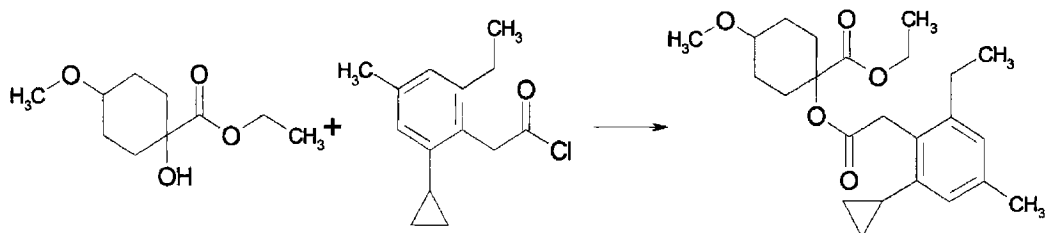


[1649] 首先将 50mg (0.14mmol) 实施例 I-2-a-1 的化合物引入 5ml 二氯甲烷中, 加入 17mg (0.168mmol) 三乙胺和 20mg (0.168mmol) 新戊酰氯, 并将混合物在室温搅拌 12h。将混合物浓缩, 并将粗产品通过硅胶柱 RP18 色谱法进行纯化 (乙腈 / 水)。

[1650] 产率: 60mg (理论产率的 97%), $\log P = 5.03$

[1651] 实施例 (III-1)

[1652]

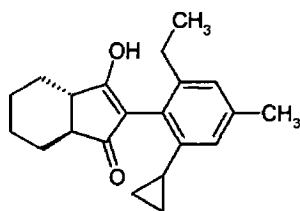


[1653] 在 120°C 浴温下, 将 0.854g (4.224mmol) 4-甲氧基-1-羟基-环己烷羧酸乙酯和 1g (4.224mmol) 2-环丙基-6-乙基-4-甲基-苯乙酰氯搅拌 6h, 并在冷却后, 用旋转蒸发器脱气, 将剩余物溶解在甲基叔丁基醚中并用 5% 浓度的氢氧化钠水溶液洗涤, 随后干燥有机相并用旋转蒸发器浓缩。

[1654] 产率: 0.59g (理论产率的 35%) 油, $\log P = 5.15$

[1655] 实施例 I-6-a-1

[1656]



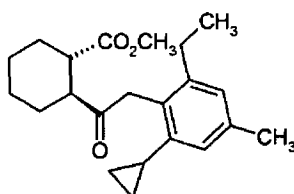
[1657] 首先将 0.58g (1.7mmol) 实施例 VIII-1 的化合物和 0.38g 叔丁醇钾 (3.4mmol) 引入 10ml 无水 DMF 中, 并在 50°C 加热 3h。冷却后, 将混合物加入冰水中, 用 2N 盐酸酸化至 pH2 并用乙酸乙酯萃取。有机相用水洗涤两次、干燥 (硫酸钠) 并用旋转蒸发器浓缩。使用己烷 / 乙酸乙酯 (v/v = 70:30) 进行硅胶色谱纯化得到无色晶体形式的 286mg (54%) 实施例 I-6-a-1 的化合物。

[1658] 熔点: 189-190°C

[1659] $^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$, 400MHz): $\delta = 0.45$ 和 0.67 (各自为 mc, 各自为 1H), 1.38 和 1.62 (各自为 mc, 各自为 2H), 1.80 (mc, 1H), 2.22 (s, 3H)

[1660] 实施例 VIII-1

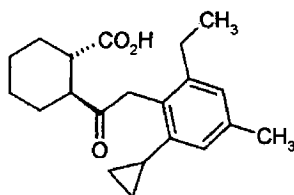
[1661]



[1662] 将 1.50g (4.6mmol) 实施例 XXXVII-1 化合物的 30ml 丙酮溶液、1.30g 碳酸钾和 1.96g (13.8mmol) 碘代甲烷一起在回流状态下沸腾 4h, 然后溶于乙酸乙酯中、用水摇振并干燥 (硫酸镁), 并将溶剂蒸馏出。用乙酸乙酯 / 己烷 (v/v = 70:30) 硅胶柱色谱法进行纯化得到 1.23g (78%) 式 (VIII-1) 的无色固态化合物, 熔点 84-85℃。

[1663] 实施例 XXXVII-1

[1664]

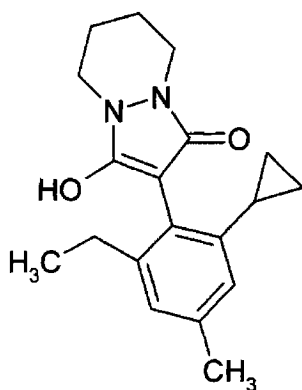


[1665] 在 -30℃, 将 3.38g (13.9mmol) 2-环丙基-6-乙基-4-甲基苯基乙酸甲酯缓慢地逐滴加入由 3.5g 二乙胺的 25ml THF 溶液和 14ml 2.5M 正丁基锂的己烷溶液制备的二乙基氨基锂的溶液中, 并将混合物在室温下再搅拌 30min。然后在 -20℃ 添加溶于 10ml THF 中的 2.15g (13.9mmol) 环己烷-1,2-二羧酸酐, 并将混合物在室温搅拌 12h。添加 30ml 饱和的氯化铵溶液, 覆以乙酸乙酯层, 用水洗涤、干燥 (硫酸镁) 并用旋转蒸发仪浓缩得到约 5.4g 固体, 无需进一步纯化, 向其中加入 2.2g 氢氧化钾的 50ml 水溶液, 并将该混合物加热回流 24h。然后用 2N 盐酸将混合物酸化至 pH2, 通过抽吸过滤出得到的沉淀的固体。

[1666] 得到 1.68g (37%) 式 (XXXVII-1) 的淡黄色晶体形态化合物, 熔点 187-188℃。

[1667] 实施例 I-8-a-1

[1668]



[1669] 首先将 0.992g (9mmol) 叔丁醇钾引入 35ml 无水的 N,N-二甲基甲酰胺中。然后逐滴加入 1.1g 实施例 XII-1 化合物的 N,N-二甲基甲酰胺溶液, 并将混合物在 80℃ 搅拌 2h。添加冰水并将该混合物用浓盐酸酸化至 pH1, 并用二氯甲烷萃取, 干燥萃取液并用旋转蒸发仪在减压下浓缩。

[1670] 产率: 0.75g (≡理论产率的 86%)

[1671] CDCl_3 中的 $^1\text{H-NMR}$ 数据, 400MHz:

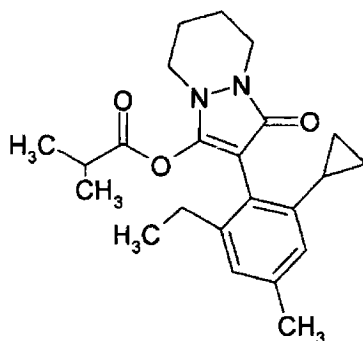
[1672] $\delta = 3.75-3.60$ (m, 4H); $2.30-2.20$ (m, 2H); $1.85-1.75$ (m, 4H); 1.55 (m, 1

^{cy}Pr-H) ;

[1673] 0.90 (m, 1 ^{cy}Pr-H) ; 0.85 (m, 1 ^{cy}Pr-H) ; 0.75 (m, 1 ^{cy}Pr-H) ; 0.65 (m, 1 ^{cy}Pr-H) ppm。

[1674] 实施例 I-8-b-1

[1675]



[1676] 首先将 0.15g (0.5mmol) 实施例 I-8-a-1 的化合物和 0.113g (1mmol) 碳酸钾引入四氢呋喃中,并在室温下添加异丁基氯 (0.04ml)。反应 3h 之后,在减压下蒸发掉溶剂,向剩余物中添加水,用乙酸乙酯萃取混合物,并将萃取液再次在减压下浓缩。

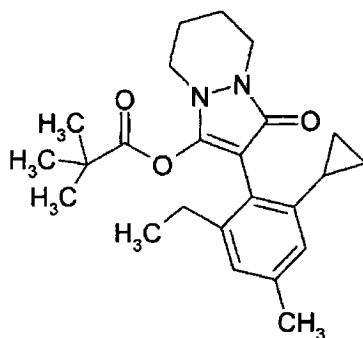
[1677] 产率: 0.12g (理论产率的 70%)

[1678] CDCl₃ 中的 ¹H-NMR 数据, 400MHz :

[1679] δ = 6.85 (s, 1H) ; 6.55 (s, 1H) ; 3.90 (m, 1H) , 3.80 (m, 1H) ; 3.35 (m, 2H) ; 2.65-2.55 (m, 2H) ; 2.50 (七重峰, 1H) ; 2.25 (s, 3H) ; 1.95 (m, 2H) ; 1.85 (m, 2H) ; 1.80 (m, 1 ^{cy}Pr-H) ; 1.15 (tr, 3H) ; 1.05 (m, 6H) ; 0.75 (m, 2 ^{cy}Pr-H) ; 0.60 (m, 1 ^{cy}Pr-H) ; 0.55 (m, 1 ^{cy}Pr-H) ppm。

[1680] 类似于实施例 (I-8-b-1), 得到实施例 (I-8-b-2)

[1681]

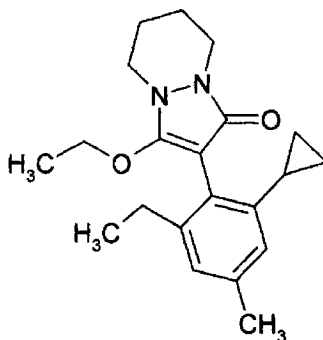


[1682] CDCl₃ 中的 ¹H-NMR 数据, 400MHz :

[1683] δ = 6.85 (s, 1H) ; 6.50 (s, 1H) ; 3.90 (m, 1H) , 3.80 (m, 1H) ; 3.35 (m, 2H) ; 2.60-2.40 (m, 2H) ; 2.25 (s, 3H) ; 1.95 (m, 2H) ; 1.85 (m, 2H) ; 1.80 (m, 1 ^{cy}Pr-H) ; 1.15 (tr, 3H) ; 1.05 (s, 9H) ; 0.80 (m, 2 ^{cy}Pr-H) ; 0.60 (m, 1 ^{cy}Pr-H) ; 0.55 (m, 1 ^{cy}Pr-H) ppm。

[1684] 类似于实施例 I-8-b-1, 得到实施例 I-8-c-1

[1685]

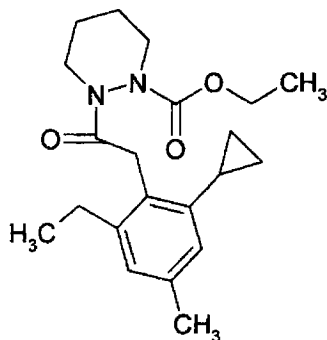


[1686] CDCl_3 中的 ^1H -NMR 数据, 400MHz :

[1687] $\delta = 6.90 (\text{s}, 1\text{H}) ; 6.60 (\text{s}, 1\text{H}) ; 4.15 (\text{q}, 2\text{H}) ; 3.90-3.80 (\text{m}, 2\text{H}) , 3.40 (\text{tr}, 2\text{H}) ; 2.65-2.45 (\text{m}, 2\text{H}) ; 2.25 (\text{s}, 3\text{H}) ; 1.95 (\text{m}, 2\text{H}) ; 1.85 (\text{m}, 2\text{H}) ; 1.80 (\text{m}, 1 \text{ } ^\text{cyPr-H}) ; 1.20 (\text{tr}, 3\text{H}) ; 1.15 (\text{tr}, 3\text{H}) ; 0.75 (\text{m}, 2 \text{ } ^\text{cyPr-H}) ; 0.65 (\text{m}, 1 \text{ } ^\text{cyPr-H}) ; 0.55 (\text{m}, 1 \text{ } ^\text{cyPr-H}) \text{ ppm}。$

[1688] 实施例 XII-1

[1689]



[1690] 将 2.28ml (16mmol) 三乙胺的无水四氢呋喃溶液添加到 1.7g (8mmol) 实施例 XXX-3 的化合物中, 添加 2.46g (11mmol) 六氢哒嗪肼基甲酸乙酯, 10min 后, 再逐滴添加 2.28ml (16mmol) 三乙胺, 之后立即逐滴添加 0.73ml (8mmol) 氯氧化磷。将该溶液加热回流 30min, 除去溶剂, 将剩余物溶于乙酸甲酯, 并将该混合物用水洗涤两次、干燥并浓缩。将剩余物溶于正庚烷并通过少量硅胶过滤。浓缩滤液。

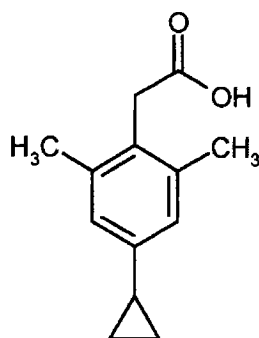
[1691] 产率: 2.3g ($\approx$ 理论产率的 74%)

[1692] CDCl_3 中的 ^1H -NMR 数据, 400MHz :

[1693] $\delta = 6.85 (\text{s}, 1\text{H}) ; 6.75 (\text{s}, 1\text{H}) ; 4.55 (\text{dbr}, 1\text{H}) ; 4.30-4.20 (\text{mbr}, 3\text{H}) ; 4.00 (\text{d}, 1\text{H}) ; 3.80 (\text{d}, 1\text{H}) , 2.95 (\text{mbr}, 1\text{H}) ; 2.75 (\text{trbr}, 1\text{H}) ; 2.55 (\text{q}, 2\text{H}) ; 2.25 (\text{s}, 3\text{H}) ; 1.80 (\text{m}, 1 \text{ } ^\text{cyPr-H}) ; 1.75-1.60 (\text{mbr}, 4\text{H}) ; 1.15 (\text{tr}, 3\text{H}) ; 0.90-0.75 (\text{m}, 2 \text{ } ^\text{cyPr-H}) ; 0.70-0.55 (\text{m}, 2 \text{ } ^\text{cyPr-H}) \text{ ppm}。$

[1694] 实施例 XXX-1

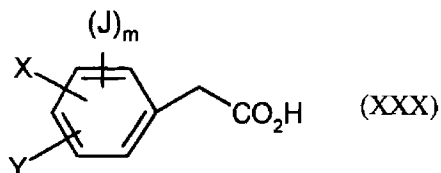
[1695]



[1696] 首先将 4.8g 实施例 (XXXIV-2) 的化合物引入 200ml 四氢呋喃中, 添加 0.5g 溶解于 80ml 水中的氢氧化锂, 并将混合物在室温下搅拌约 70h。用旋转蒸发器除去四氢呋喃, 用 1N HCl 将水相调至 pH1, 然后将水相在室温下搅拌 10min, 并通过釉料抽吸过滤出沉淀物。将剩余物溶于乙酸乙酯中, 将混合物用硫酸钠干燥并用旋转蒸发器浓缩, 将剩余物溶于 30ml 正庚烷, 将混合物超声处理 10min 并通过釉料抽吸过滤, 干燥产物。得到 4.0g 无色固体 (理论产率的 89%)。熔点: 138°C。

[1697] 类似于实施例 (XXX-1) 并根据对制备过程的概述, 得到以下式 (XXX) 的化合物:

[1698]



[1699]

实施例序号	m	J	X	Y	熔点 °C
XXX-2	1	4-	2-C ₂ H ₅	6-CH ₃	100
XXX-3	1	2-	6-C ₂ H ₅	4-CH ₃	139
XXX-4	1	2-	4-CH ₃	6-CH ₃	144
XXX-5	1	6-	2-Cl	4-CH ₃	158
XXX-6	1	2-	6-CH ₃	4-Cl	224-226
XXX-7	2	2,4-	6-C ₂ H ₅	H	*3.91 (s, 2H, CH ₂ CO ₂) 0.93, 0.62 (2m, 4H, CH ₂ (环丙基))

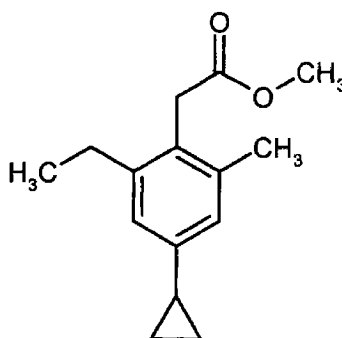
[1700]

实施例序号	m	J	X	Y	熔点℃
XXX-8	2	2,4- 	6-CH ₃	H	112
XXX-9	2	2,6- 	4-CH ₃	H	*4.18 (s, 2H, CH ₂ CO ₂) 0.91, 0.64 (2m, 4H, CH ₂ (环丙基))

[1701] *¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) : ppm 计的位移 δ

[1702] 实施例 XXXIV-1

[1703]

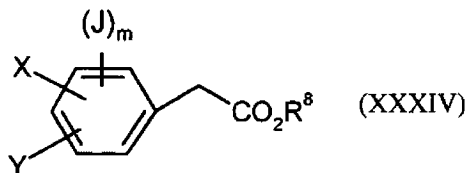


[1704] 首先将 3g 4-溴-2-乙基-6-甲基苯基乙酸甲酯引入 115ml 甲苯和 5.7ml 水中, 并将该装置用真空 / 氩气冲洗 3x。然后添加 1.24g 环丙烷硼酸、5.27g 磷酸二氢钾、0.31g 三环己基膦和 0.12g 乙酸钡, 并将该混合物在预热的油浴中在回流状态下加热。将混合物在回流状态下搅拌 8h。将混合物倒入 500ml 0.5N HCl 中并用 150ml 甲苯萃取 3x, 合并有机相并用 100ml 氯化钠溶液洗涤, 粗略进行相分离, 有机相用 Na₂SO₄ 干燥并用旋转蒸发仪浓缩。剩余物通过乙酸乙酯 / 正庚烷 (5:95-100:0) 在 Biotage 色谱站进行分离。得到 2.5g 油状剩余物 (理论产率的 98%)。

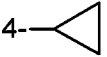
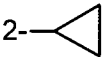
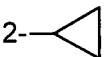
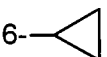
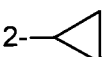
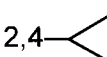
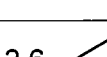
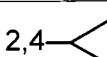
[1705] *¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) : δ : 1.81 (m, 1H, CH-cycPr), 3.66 (s, 2+3H, CH₂-COOCH₃) ppm。

[1706] 类似于实施例 (XXXIV-1) 并根据对制备过程的概述, 得到以下式 (XXXIV) 的化合物:

[1707]



[1708]

实施例序号	m	J	X	Y	R ⁸	熔点℃
XXXIV-2	1		2-CH ₃	6-CH ₃	CH ₃	*1.81 (m, 1H, CH-cyc-Pr) 3.64 (s, 2H, CH ₂ CO ₂ CH ₃) 3.67 (s, 3H, CH ₂ -CO ₂ CH ₃)
XXXIV-3	1		6-C ₂ H ₅	4-CH ₃	CH ₃	*1.89 (m, 1H, CH-cyc-Pr) 3.89 (s, 2H, CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃) 4.13 (s, 3H, CO ₂ CH ₂ CH ₃)
XXXIV-4	1		4-CH ₃	6-CH ₃	CH ₃	无需进一步表征而被转化为 实施例(XXX-4)
XXXIV-5	1		2-Cl	4-CH ₃	CH ₃	*1.86 (m, 1H, CH-cyc-Pr) 3.69 (s, 3H, CO ₂ CH ₃)
XXXIV-6	1		4-Cl	6-CH ₃	CH ₃	*3.88 ppm (s, 2H, CH ₂ -COO), 3.68 ppm (s, 3H, OCH ₃), 0.93 和 0.62 ppm (各自为 m, 2H, CH ₂ (环丙基))
XXXIV-7	2		6-CH ₃	H	CH ₃	*3.89 ppm (s, 2H, CH ₂ -COO), 3.68 ppm (s, 3H, OCH ₃), 0.90 ppm (m, 4H, CH ₂ (环丙基)), 0.66 和 0.60 ppm (各自为 m, 2H, CH ₂ (环丙基))
XXXIV-8	2		4-CH ₃	H	CH ₃	*4.12 ppm (s, 2H, CH ₂ -COO), 3.68 ppm (s, 3H, OCH ₃), 0.89 和 0.62 ppm (各自为 m, 4H, CH ₂ (环丙基))
XXXIV-9	2		6-C ₂ H ₅	H	CH ₃	*3.90 ppm (s, 2H, CH ₂ -COO), 3.68 ppm (s, 3H, OCH ₃), 0.89 ppm (m, 4H, CH ₂ (环丙基)), 0.66 和 0.60 ppm (各自为 m, 2H, CH ₂ (环丙基))

[1709] *¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) :ppm 计的位移 δ

[1710] 表中给出的 logP 值根据 EEC Directive 79/831Annex V.A8 通过反相柱 (C18) HPLC(High Performance LiquidChromatography) 确定。温度:43℃。

[1711] 用于测定的流动相在酸性范围内 (pH2.3):0.1%的含水磷酸、乙腈;线性梯度从 10%的乙腈至 90%的乙腈。

[1712] 用已知 logP 值的无支链的烷-2-酮(具有 3-16 个碳原子)进行校准(在两个相连的烷酮之间使用线性插值法通过保留时间确定 logP 值)。

[1713] 用 200nm-400nm 的 UV 光谱以色谱信号的最大值确定 λ 的最大值。

[1714] 实施例 A

[1715] 除草剂出苗前作用

[1716] 将单子叶和双子叶杂草及作物植物的种子放入木纤维盆中的砂壤土中并用土覆盖。然后将添加了 0.2%湿润剂的制剂形式为可湿性粉剂(WP)或乳油(EC)的试验化合物以水悬浮剂的形式以 800l/ha(换算的)的水施用率施用于覆盖土壤的表面。

[1717] 处理后,将盆置于温室中并保持在对照植物而言良好的生长条件下。在 3 周试验期之后,通过与未处理的对照植株进行比较视觉评估对试验植株出苗的损害(除草活性以百分比(%)计:100%活性=植株均死亡,0%活性=与对照植株相同)。

[1718] 此处,以下化合物在 320g/ha 的施用率下,例如对防治多花黑麦草(*Lolium multiflorum*)和狗尾草(*Setaria viridis*)具有 $\geq 80\%$ 的活性:实施例:I-1-a-5, I-1-a-6, I-1-a-7, I-1-a-8, I-1-a-10, I-1-a-11, I-1-a-12, I-1-a-14, I-1-a-15, I-1-a-17, I-1-a-18, I-1-a-19, I-1-b-1, I-1-b-2, I-1-b-6, I-1-b-9, I-1-b-10, I-1-c-1, I-1-c-2, I-1-c-7, I-1-c-8, I-1-c-10, I-1-c-12, I-1-c-13, I-1-c-14, I-1-c-15, I-1-c-16, I-1-c-17。

[1719] 实施例 B

[1720] 除草剂出苗后作用

[1721] 将单子叶和双子叶杂草及作物植物的种子放入木纤维盆中的砂壤土中,用土壤覆盖并在温室中在良好的生长条件下培育。播种后两至三周,在一叶期对试验植株进行处理。然后将添加了 0.2%湿润剂的制剂形式为可湿性粉剂(WP)或乳油(EC)的试验化合物以含水悬浮剂的形式以 800l/ha(换算的)的水施用率喷洒在植株的绿色部位上。将试验植株在温室中在最适宜的生长条件下保持约 3 周后,通过与未处理的对照植株相比较视觉评价制剂的活性(除草剂活性以百分比(%)计:100%活性=植株均死亡,0%活性=与对照植株相同)。

[1722] 此处,以下化合物在 320g/ha 的施用率下,例如对防治多花黑麦草和狗尾草具有 $\geq 90\%$ 的活性:实施例 I-1-c-1。

[1723] 此处,以下化合物在 80g/ha 的施用率下,例如对防治多花黑麦草和狗尾草具有 $\geq 80\%$ 的活性:实施例:I-1-a-2, I-1-a-5, I-1-a-6, I-1-a-7, I-1-a-8, I-1-a-10, I-1-a-11, I-1-a-12, I-1-a-14, I-1-a-15, I-1-a-17, I-1-a-18, I-1-a-19, I-1-b-1, I-1-b-6, I-1-b-9, I-1-b-10, I-1-c-3, I-1-c-7, I-1-c-8, I-1-c-10, I-1-c-13, I-1-c-14, I-1-c-15。

[1724] 实施例 C

[1725] 除草剂出苗后作用

[1726] 将单子叶和双子叶杂草及作物植物的种子放入木纤维盆或塑料盆中的砂壤土中,用土覆盖并在温室中在良好生长条件下培育,在生长期期间,也在温室外进行户外培育。播种后两至三周,在一叶至三叶期对试验植株进行处理。将添加了湿润剂(0.2-0.3%)的制剂形式为可润湿粉剂(WP)或液剂(EC)的试验化合物后以多种剂量以 300l/ha(换算的)

的水施用率喷洒至植株和土壤表面。试验植株处理之后三至四周,通过与未经处理的对照植株相比视觉评估制剂的活性(除草剂活性以百分比(%)计:100%活性=植物均死亡,0%活性=与未处理的对照相同)。

[1727] 使用安全剂

[1728] 如果另外测试关于安全剂是否可改进试验物质对作物植物的植物相容性,则使用以下选项施用安全剂:

[1729] - 将作物植物的种子在播种之前用安全剂物质拌种(安全剂的量基于种子的重量以百分比表述)

[1730] - 在施用试验物质之前,用安全剂以每公顷一定的施用率喷洒作物植物(通常在施用试验物质之前1天)

[1731] - 将安全剂与试验物质以桶混物的形式一起施用(安全剂的量以g/ha或基于除草剂以比例表述)。

[1732] 通过比较试验物质在经过或未经过安全剂处理的情况下对作物植物的效果,可评价安全剂物质的活性。

[1733] 温室中的容器试验,在施用除草剂之前1天用安全剂处理

[1734]

表 1

	施用率 g 活性成分/ha	施用之后 10 天	施用之后 28 天
		夏季大麦 观测到的 (%)	夏季大麦 观测到的 (%)
I-1-a-5	50	80	40
	25	70	25
	12.5	50	15
I-1-a-5 + 吡咯二酸	50 + 100	60	15
	25 + 100	40	10
	12.5 + 100	20	0

表 2

	施用率 g 活性成分/ha	施用之后 10 天	施用之后 28 天
		夏季小麦 观测到的 (%)	夏季小麦 观测到的 (%)
I-1-a-5	50	70	75
	25	70	60
	12.5	60	40
	6.25	50	10
I-1-a-5 + 吡咯二酸	50 + 100	40	25
	25 + 100	20	20
	12.5 + 100	10	5
	6.25 + 100	3	0

[1735]

表 3		施用之后 10 天
I-1-a-12	施用率 g 活性成分/ha	夏季小麦 观测到的 (%)
	25	50
	12.5	40
	6.25	10
I-1-a-12 + 吡咯二酸	25 + 100	20
	12.5 + 100	15
	6.25 + 100	0

[1736]

表 4		施用之后 10 天	施用之后 28 天
I-1-a-12	施用率 g 活性成分/ha	夏季小麦 观测到的 (%)	夏季小麦 观测到的 (%)
	50	60	65
	25	60	65
	12.5	50	25
	6.25	30	5
I-1-a-12 + 吡咯二酸	50 + 100	5	10
	25 + 100	5	5
	12.5 + 100	3	0
	6.25 + 100	2	0

[1737]

表 5		施用之后 28 天	
I-1-a-14	施用率 g 活性成分/ha	夏季大麦 观测到的 (%)	夏季小麦 观测到的 (%)
	100		85
	50	70	75
	25	60	50
	12.5	20	20
I-1-a-14 + 吡咯二酸	100 + 100		40
	50 + 100	30	30
	25 + 100	25	20
	12.5 + 100	5	5

[1738]

表 6

	施用率 g 活性成分/ha	施用之后 10 天	施用之后 28 天
		夏季大麦 观测到的 (%)	夏季大麦 观测到的 (%)
I-1-a-18	100	35	20
	50	25	10
	25	15	
	12.5	10	
I-1-a-18 + 吡咯二酸	100 + 50	20	5
	50 + 50	15	5
	25 + 50	10	
	12.5 + 50	5	

[1739]

表 7

	施用率 g 活性成分/ha	施用之后 10 天
		夏季小麦 观测到的 (%)
I-1-a-18	100	40
	50	25
	25	15
	12.5	10
I-1-a-18 + 吡咯二酸	100 + 50	10
	50 + 50	5
	25 + 50	5
	12.5 + 50	0

[1740]

表 8

	施用率 g 活性成分/ha	施用之后 10 天
		夏季大麦 观测到的 (%)
I-1-a-7	50	60
	25	50
	12.5	10
I-1-a-7 + 吡咯二酸	50 + 100	40
	25 + 100	10
	12.5 + 100	7

[1741]

表 9

	施用率 g 活性成分/ha	施用之后 28 天
		夏季小麦 观测到的 (%)
I-1-a-7	100	80
	50	70
	25	60
	12.5	30
I-1-a-7 + 吡咯二酸	100 + 100	50
	50 + 100	40
	25 + 100	20
	12.5 + 100	10

[1742]

表 10

	施用率 g 活性成分/ha	施用之后 10 天
		夏季小麦 观测到的 (%)
I-1-a-8	100	30
	50	30
	25	25
I-1-a-8 + 吡咯二酸	100 + 100	5
	50 + 100	0
	25 + 100	0

[1743]

表 11

	施用率 g 活性成分/ha	施用之后 10 天	施用之后天 28
		夏季小麦 观测到的 (%)	夏季小麦 观测到的 (%)
I-1-a-9	25	65	50
	12.5	60	
I-1-a-9 + 吡咯二酸	25 + 100	50	25
	12.5 + 100	15	

[1744]

表 12

	施用率 g 活性成分/ha	施用之后 10 天	施用之后 28 天
		夏季大麦 观测到的 (%)	夏季大麦 观测到的 (%)
I-1-b-1	50		80
	25	65	30
	12.5	30	10
I-1-b-1 + 吡咯二酸	50 + 100		30
	25 + 100	30	15
	12.5 + 100	5	0

[1745]

表 13

	施用率 g 活性成分/ha	施用之后 10 天	施用之后 28 天
		夏季小麦 观测到的 (%)	夏季小麦 观测到的 (%)
I-1-b-1	100		95
	50		90
	25	60	40
	12.5	50	
I-1-b-1 + 吡咯二酸	100 + 100		40
	50 + 100		20
	25 + 100	25	0
	12.5 + 100	15	

[1746]

表 14

	施用率 g 活性成分/ha	施用之后 10 天	施用之后 10 天
		夏季大麦 观测到的 (%)	夏季小麦 观测到的 (%)
I-1-c-13	50	30	40
	25	20	30
	12.5	5	20
I-1-c-13 + 吡咯二酸	50 + 50	10	30
	25 + 50	5	20
	12.5 + 50	0	5

[1747]

表 15

	施用率 g 活性成分/ha	施用之后 10 天	施用之后 28 天
		夏季大麦 观测到的 (%)	夏季大麦 观测到的 (%)
I-1-c-7	100	90	95
	50	60	50
	25	40	
	12.5	10	
I-1-c-7 + 吡咯二酸	100 + 100	50	25
	50 + 100	10	5
	25 + 100	3	
	12.5 + 100	0	

[1748]

表 16

	施用率 g 活性成分/ha	施用之后 10 天	施用之后 28 天
		夏季小麦 观测到的 (%)	夏季小麦 观测到的 (%)
I-1-c-7	50		80
	25	60	20
	12.5	20	10
I-1-c-7 + 吡咯二酸	50 + 100		20
	25 + 100	30	10
	12.5 + 100	10	5

[1749] 实施例 D

[1750] 猿叶甲 (Phaedon) 试验 (喷洒处理)

[1751] 溶剂: 78 重量份丙酮

[1752] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[1753] 乳化剂: 0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[1754] 为制备合适的活性化合物制剂, 将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合, 并将该浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。

[1755] 将甘蓝 (*Brassica pekinensis*) 的圆叶片用所需浓度的活性化合物制剂进行喷洒, 并在干燥之后, 接种芥菜甲虫 (*Phaedoncochleariae*) 的幼虫。

[1756] 经所需时间段之后, 确定以 % 计的活性。100% 意指所有的甲虫幼虫被杀死, 0% 意指没有甲虫幼虫被杀死。

[1757] 本试验中, 例如, 制备实施例的以下化合物在 500g/ha 的施用率时显示出 $\geq 80\%$ 的活性: 实施例: I-1-a-2, I-1-a-4, I-1-a-6, I-1-a-7, I-1-a-10, I-1-a-11, I-1-a-12, I-1-a-14, I-1-a-24, I-1-a-25, I-1-b-5, I-1-b-11, I-1-b-13, I-1-c-7, I-1-c-12, I-1-c-20, I-1-c-22, I-1-c-23, I-1-d-1。

[1758] 实施例 E

[1759] 桃蚜 (*Myzus*) 试验 (MYZUPE 喷洒处理)

[1760] 溶剂： 78 重量份丙酮

[1761] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[1762] 乳化剂：0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[1763] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合，并将该浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。

[1764] 将被所有阶段的桃蚜 (*Myzus persicae*) 侵染的甘蓝 (*Brassica pekinensis*) 的圆叶片用所需浓度的活性化合物制剂进行喷洒。

[1765] 经所需时间段之后，确定以%计的活性。100%意指所有的蚜虫被杀死；0%意指没有蚜虫被杀死。

[1766] 本试验中，例如，制备实施例的以下化合物在 500g/ha 的施用率时显示出 $\geq 90\%$ 的活性：实施例：I-1-a-2, I-1-a-4, I-1-a-6, I-1-a-7, I-1-a-9, I-1-a-11, I-1-a-12, I-1-a-14, I-1-a-15, I-1-a-17, I-1-a-20, I-1-a-22, I-1-b-3, I-1-b-4, I-1-b-6, I-1-b-10, I-1-b-13, I-1-c-1, I-1-c-8, I-1-c-9, I-1-c-14, I-1-c-15, I-1-c-19。

[1767] 实施例 F

[1768] 叶螨属 (*Tetranychus*) 试验；OP 抗性 (TETRUR 喷洒处理)

[1769] 溶剂： 78 重量份丙酮

[1770] 1.5 重量份二甲基甲酰胺

[1771] 乳化剂：0.5 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[1772] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合，并将该浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。

[1773] 将被所有阶段的温室红叶螨 (*Tetranychus urticae*) 侵染的菜豆叶 (*Phaseolus vulgaris*) 的圆叶片用所需浓度的活性化合物制剂进行喷洒。

[1774] 经所需时间段之后，确定以%计的活性。100%意指所有的叶螨被杀死；0%意指没有叶螨被杀死。

[1775] 本试验中，例如，制备实施例的以下化合物在 100g/ha 或 20g/ha 的施用率时显示出 $\geq 80\%$ 的活性：实施例：I-1-a-4, I-1-a-5, I-1-a-6, I-1-a-7, I-1-a-8, I-1-a-9, I-1-a-10, I-1-a-11, I-1-a-14, I-1-a-17, I-1-a-19, I-1-a-20, I-1-a-25*, I-1-b-4, I-1-b-8, I-1-b-9, I-1-b-13, I-1-b-15, I-1-c-9, I-1-c-12, I-1-c-13, I-1-c-14, I-1-c-15, I-1-c-16, I-1-c-20, I-1-c-25, I-1-d-1, I-8-b-2。

[1776] 实施例 G

[1777] 桃蚜试验、溶液培养处理 (MYZUPE 体系)

[1778] 溶剂： 7 重量份二甲基甲酰胺

[1779] 乳化剂：2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[1780] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合，并将该浓液用水稀释至所需浓度。

[1781] 将活性化合物制剂与水混合。所述浓度指的是每体积单位水的活性化合物的量 (mg/l = ppm)。将经处理的水装入含豌豆植株 (*Pisum sativum*) 的容器中，然后将其用桃蚜 (*Myzus persicae*) 侵染。

[1782] 经所需时间段之后，确定以百分比计的死亡率。100%意指所有的蚜虫被杀死；0%

意指没有蚜虫被杀死。

[1783] 本试验中,例如,制备实施例的以下化合物在 20ppm 的浓度下显示出 $\geq 90\%$ 的活性:实施例:I-1-a-4。

[1784] 实施例 H

[1785] 根结线虫 (*Meloidogyne*) 试验 (MELGIN 喷洒处理)

[1786] 溶剂: 80 重量份丙酮

[1787] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合,并将该浓液用水稀释至所需浓度。

[1788] 将沙、活性化合物溶液、南方根结线虫 (*Meloidogyne incognita*) 的卵-幼虫悬浮液和莴苣种子装入容器。莴苣种子萌芽并且植株发展。在根部,形成虫瘿 (gall)。

[1789] 经所需时间段之后,通过虫瘿的形成确定以百分比计的杀线虫活性。100%意指没有发现虫瘿;0%意指经处理植株上的虫瘿的数目相当于未处理对照植株。

[1790] 本试验中,例如,制备实施例的以下化合物在 20ppm 的施用率下显示出 $\geq 80\%$ 的活性:实施例:I-1-a-7, I-1-a-12。

[1791] 实施例 I

[1792] 铜绿蝇 (*Lucilia cuprina*) 试验 (LUCICU)

[1793] 溶剂: 二甲基亚砷

[1794] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合,并将该浓液用水稀释至所需浓度。

[1795] 将用所需浓度的活性化合物制剂处理过的含马肉的容器接种铜绿蝇幼虫。

[1796] 经所需时间段之后,确定以百分比计的死亡率。100%意指所有的幼虫被杀死;0%意指没有幼虫被杀死。

[1797] 本试验中,例如,制备实施例的以下化合物在 100ppm 的施用率下显示出 $\geq 80\%$ 的活性:实施例:I-1-a-4, I-1-b-4, I-1-c-3。

[1798] 实施例 J

[1799] 微小牛蜱 (*Boophilus microplus*) 试验 (BOOPMI 注射)

[1800] 溶剂:二甲基亚砷

[1801] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合,并将该浓液用溶剂稀释至所需浓度。

[1802] 将活性化合物溶液注射到微小牛蜱 (*Boophilus microplus*) 腹中,将该动物转移到器皿中并贮存在气温调节室中。

[1803] 经所需时间段之后,确定以百分比计的死亡率。100%意指没有蜱虫产受精卵。

[1804] 本试验中,例如,制备实施例的以下化合物在 20 μ g/ 动物的 施用率下显示出 $\geq 80\%$ 的活性:实施例:I-1-a-1, I-1-a-2, I-1-a-4, I-1-a-6, I-1-b-4, I-1-c-3。

[1805] 实施例 K

[1806] 临界浓度试验 / 土壤昆虫-转基因植物的处理

[1807] 试验昆虫: *Diabrotica balteata*- 在土壤中的幼虫

[1808] 溶剂: 7 重量份丙酮

[1809] 乳化剂:1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[1810] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合,添加所述量的乳化剂并将该浓液用水稀释至所需浓度。

[1811] 将活性化合物制剂浇泼在土壤上。此处,制剂中活性化合物的浓度实质上并不重要;只有以 ppm(mg/l) 表示的每体积单位的土壤中活性化合物的重量才是重要的。将土装入 0.25l 的盆中,并使其保持在 20℃。

[1812] 制备之后,立即将 5 粒栽培种 YIELD GUARD(MonsantoComp., USA 的商标)的预先发芽的玉米粒放入每个盆中。2 天之后,将合适的试验昆虫放入经处理的土壤中。再过 7 天之后,通过计算出苗的玉米植株确定活性化合物的活性(1 株植株= 20%活性)。

[1813] 实施例 L

[1814] 烟芽夜蛾 (*Heliothis virescens*) 试验 - 转基因植物的处理

[1815] 溶剂: 7 重量份丙酮

[1816] 乳化剂:1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[1817] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和所述量的乳化剂混合,并将该浓液用水稀释至所需浓度。

[1818] 将栽培种 Roundup Ready(Monsanto Comp. USA 的商标)的大豆芽 (*Glycine max*) 通过浸入所需浓度的活性化合物制剂中进行处理,并将其在叶仍湿润的情况下接种烟草蚜虫烟芽夜蛾。

[1819] 经所需时间段之后,确定昆虫的死亡率。

[1820] 实施例 M 通过铵盐 / 磷盐与渗透剂的结合提高活性

[1821] 桃蚜 (*Myzus persicae*) 试验

[1822] 溶剂: 7 重量份二甲基甲酰胺

[1823] 乳化剂:2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[1824] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将该浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。应用渗透剂(菜籽油甲基酯 500EW)、铵盐或磷盐,或者铵盐和渗透剂(菜籽油甲基酯 500EW),将它们各自加入 1000ppm 浓度的喷雾液剂中。

[1825] 将被桃蚜 (*Myzus persicae*) 严重侵染的铃状椒 (*Capsicum annuum*) 植株通过用所需浓度的活性化合物制剂喷洒至溢流点 (run off point) 进行处理。

[1826] 经所需时间段之后,确定以%计的死亡率。100%意指所有该动物被杀死;0%意指没有该动物被杀死。

[1827] 本试验中,例如,制备实施例的以下化合物显示出良好的活性:见表

[1828] 表

[1829]

活性化合物	浓度 (ppm)	6 天之后的死亡率 (%)	+AS 1000ppm	+RME 1000ppm	+AS+RME 各自为 1000ppm
I-1-a-15	204	955	9515	9555	9895

[1830] AS = 硫酸铵

[1831] 实施例 N

[1832] 棉蚜 (*Aphis gossypii*) 试验

[1833] 溶剂: 7 重量份二甲基甲酰胺

[1834] 乳化剂 :2 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[1835] 为制备合适的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将该浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。应用渗透剂(菜籽油甲基酯 500EW)、铵盐或磷盐,或者铵盐和渗透剂(菜籽油甲基酯 500EW),将它们各自加入 1000ppm 浓度的喷雾液剂中。

[1836] 将被棉蚜(*Aphis gossypii*)严重侵染的陆地棉(*Gossypium hirsutum*)植株通过用所需浓度的活性化合物制剂喷洒至溢流点进行处理。

[1837] 经所需时间段之后,确定以%计的死亡率。100%意指所有蚜虫被杀死;0%意指没有该动物被杀死。

[1838] 本试验中,例如,制备实施例的以下化合物显示出良好的活性:见表

[1839] 表

[1840]

活性化合物	浓 度 (ppm)	6 天之后的死亡率 (%)	+AS 1000ppm	+RME 1000ppm	+AS+RME 各自为 1000ppm
1-1-a-7	20	55	65	75	99

[1841] AS = 硫酸铵

[1842] 实施例 0

[1843] 通过铵盐或磷盐提高对植株的渗入并且通过铵盐 / 磷盐与渗透剂的结合协同提高对植株的渗入。

[1844] 在本试验中,通过酶法分离出的苹果树叶表皮测量活性化合物制剂。

[1845] 使用从栽培种金冠(golden delicious)苹果树上剪切下的完全发育的叶。通过以下步骤分离表皮

[1846] - 首先用缓冲至 pH 为 3 至 4 的果胶酶溶液(0.2-2%浓度)通过真空渗入来填充经打孔并用染料对底面染色的圆叶片,

[1847] - 然后添加叠氮化钠,并且

[1848] - 放置用该方法处理过的圆叶片,直至最初的叶结构已溶解并且非细胞表皮已分离出。

[1849] 然后只使用从叶的顶面的绒毛和气孔中分离出的表皮。将其用水和 pH 值为 7 的缓冲溶液交替重复洗涤。然后将得到的洁净的表皮置于聚四氟乙烯板上并放平整,用平缓的空气流进行干燥。

[1850] 下一步中,将用该方法得到的表皮膜放入不锈钢制成的扩散池(=传送室)中供研究膜传输之用。为此,用镊子将表皮放入涂有硅酮油(silicone fat)的扩散池边缘的中间,并用也经硅酮油处理过的环状物将表皮封闭。选择这样的设置以使表皮的形态学外表面能够对着外界,即暴露于空气,而表皮原始内表面对着扩散池的内部。

[1851] 扩散池中装满 30%浓度的乙二醇 / 水溶液。为测定渗透率,将各自为 10 μ l 的以下组合物喷雾液施用于表皮的外表面。该喷雾液剂使用当地中等硬度的自来水制备。

[1852] 施用喷雾液剂之后,蒸发掉水,并将传送室倒置放入恒温箱(thermostated tap)中,该恒温箱中表皮的温度和大气湿度可通过吹到带有喷雾涂层的表皮上的平缓空气流进行调节(20°C,60%相对大气湿度)。自动采样器按一定时间间隔采样,并通过 HPLC 测定活性化合物含量。

[1853] 试验结果示于下表中。所述数值为 8-10 次测量的平均值。显而易见的是,与 RME 一起,会具有超加和(协同)效应。

[1854] 表 1

[1855]

活性化化合物				
	24 h 之后的渗透率/%			
	活性成分	活性成分 + AS (1 g/l)	活性成分 + RME (1 g/l)	活性成分 + RME (1 g/l) + AS (1 g/l)
实施例 I-1-a-21 200 ppm 的丙酮/水为 4:6 的溶液	2	1.1	35.6	56.9

[1856] RME = 菜籽油甲基酯(配置成 500EW, 所述浓度以 g 活性化合物计)

[1857] AS = 硫酸铵