(19)中华人民共和国国家知识产权局

(12)发明专利

(10)授权公告号 CN 102596968 B
(45)授权公告日 2015.05.06

(21)申请号 201080040536.6
(22)申请日 2010.07.29
(30)优先权数据
61/229,769 2009.07.30 US
(85)PCT国际申请进入国家阶段日
2012.03.13
(86)PCT国际申请的申请数据
PCT/US2010/043717 2010.07.29
(87)PCT国际申请的公布数据
WO2011/014660 EN 2011.02.03
(73)专利权人 梅里亚有限公司
地址 美国佐治亚
(72)发明人 M·D·索尔 C·Q·蒙 M·泊尔曼 E·鲍曼 R·保里尼
(74)专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商标事务所 11038
代理人 殷骏
(51)Int.Cl.
C07D 495/04(2006.01)
A01N 43/90(2006.01)
A01P 7/00(2006.01)
(56)对比文件
WO 2006047397 A1,2006.05.04, 全文.
EP 0447891 A1,1991.09.25, 全文.
WO 2007135029 A1,2007.11.29, 全文.
CN 1168671 A,1997.12.24, 全文.
US 4146716 A,1979.03.27, 全文.
审查员 耿鹏

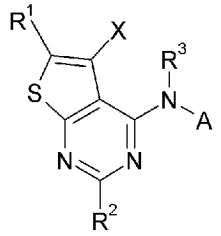
权利要求书5页 说明书68页

(54)发明名称

杀虫的4-氨基-噻吩并[2,3-d]-嘧啶化合物及其使用方法

(57)摘要

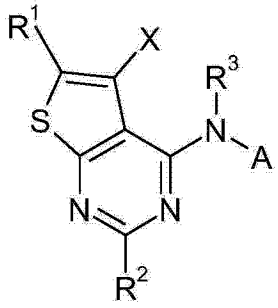
杀虫的4-氨基-噻吩并[2,3-d]-嘧啶化合物及其防除损害植物和农作物的害虫和伤害动物的寄生虫的使用方法。本发明涉及新的杀虫4-氨基-噻吩并[2,3-d]-嘧啶化合物及其新的使用方法。新的4-氨基-噻吩并[2,3-d]-嘧啶衍生物具有通式(I),其中X,R^1,R^2,R^3和A如说明书中所定义。本发明还涉及它们的对映体、非对映异构体或其农业上或兽医学上可接受的盐。本发明还涉及包含此种化合物的农业组合物和兽医组合物。本发明还涉及施用此种化合物和组合物的不同杀虫方法。



式I

CN 102596968 B

1. 用于对抗或防除昆虫、蛛形类或线虫类的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物：



(式 I)

其中

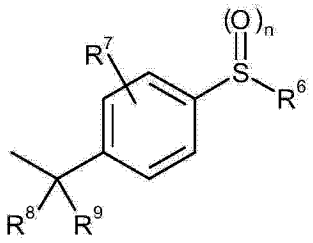
X 为卤素；

R^1选自下组：氢，卤素或 C_1-C_4- 烷基；

R^2选自下组：氢，卤素或 C_1-C_4- 烷基；

R^3选自氢或 C_1-C_4- 烷基；

A 是



(A. 2)

其中

n 是 0 或 1；

R^8和 R^9相互独立地选自氢或 C_1-C_4- 烷基；

R^6选自下组：C_1-C_{10}氟卤烷基，C_2-C_{10}氟卤烯基和 C_3-C_7氟卤环烷基；

R^7选自下组：氢或卤素；

或者其农业上或兽医学上可接受的盐。

2. 根据权利要求 1 的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中

A 是 A. 2；而

R^9选自下组：氢或 C_1-C_4- 烷基。

3. 根据权利要求 1 的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中

A 是 A. 2；

R^8为氢；而

R^9是 C_1-C_4- 烷基。

4. 根据权利要求 3 的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中

A 是 A. 2；

R^8为氢；

R^9是 C_1-C_4- 烷基；和

其中 R^8和 R^9结合至的手性碳原子处的取代基为 (S)- 构型。

5. 根据权利要求 1 的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中

A 是 A.2 ；

R^8为氢 ；和

R^9为甲基。

6. 根据权利要求 5 的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中

A 是 A.2 ；

R^8为氢 ；

R^9为甲基 ；和

其中 R^8和 R^9结合至的手性碳原子处的取代基为 (S)- 构型。

7. 根据权利要求 1 至 6 中任一项的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中

R^7为氢。

8. 根据权利要求 1 至 6 中任一项的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中

R^6是 C_1-C_{10}- 氟卤烷基。

9. 根据权利要求 1 至 6 中任一项的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中

R^6是三氟甲基。

10. 根据权利要求 1 至 6 中任一项的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中

R^3为氢。

11. 根据权利要求 1 至 6 中任一项的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中

R^2选自下组 ：氢或 C_1-C_4- 烷基。

12. 根据权利要求 1 至 6 中任一项的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中

R^2为氢。

13. 根据权利要求 1 至 6 中任一项的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中

R^1选自下组 ：氢或 C_1-C_4- 烷基。

14. 根据权利要求 1 至 6 中任一项的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中

R^1为氢或氯。

15. 根据权利要求 1 至 6 中任一项的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中

X 是卤素。

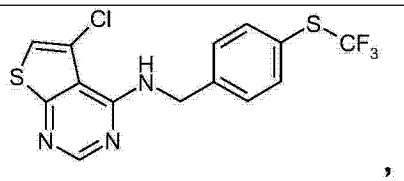
16. 根据权利要求 1 至 6 中任一项的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中

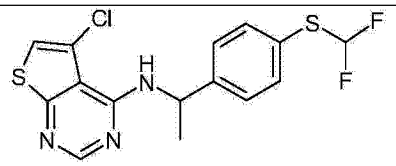
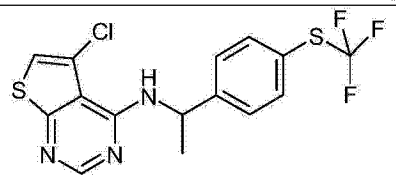
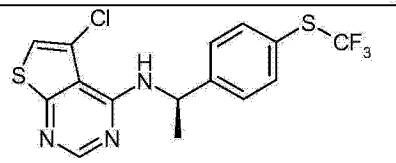
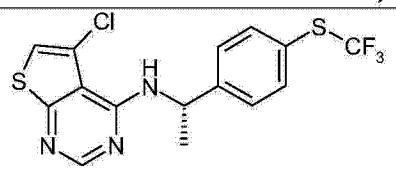
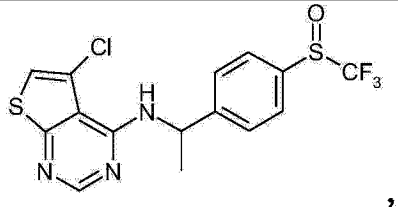
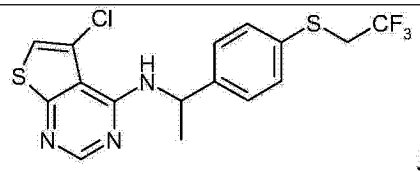
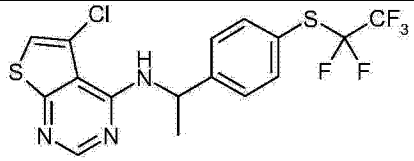
X 是氯。

17. 根据权利要求 1 至 6 中任一项的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中

n 是 0。

18. 权利要求 1 的化合物，其中所述化合物具有下述结构：

化合物实例编号	结构
C.1	

化合物 实例编号	结构
C.2	 ,
C.3	 ,
C.3-R	 ,
C.3-S	 ,
C.4	 ,
C.5	 或
C.6	

。

19. 农业或兽医学组合物，其包含有效量的至少一种如权利要求 1 至 18 任一项中所定义的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，和至少一种惰性液体和 / 或固体载体。

20. 通过将动物害虫与有效量的如权利要求 1 至 18 任一项中所定义的式 I 的氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，或包含其中至少一种化合物的组合物进行接触来对抗或防除动物害虫的方法。

21. 通过将植物或者植物生长于其中的土壤或水与有效量的如权利要求 1 至 18 任一项中所定义的式 I 的氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物或者包含其中至少一种化合物的组合物进行接触来保护农作物和生长植物免于动物害虫攻击或侵染的方法。

22. 根据权利要求 20 或 21 的方法，所述动物害虫选自下组 ：昆虫、蛛形类或线虫类害

虫。

23. 保护植物繁殖材料免于土壤昆虫类和叶面昆虫类侵袭的方法，包括将植物繁殖材料在播种之前和 / 或在催芽之后与有效量的至少一种如权利要求 1 至 18 任一项中所定义的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物或包含其中至少一种化合物的组合物进行接触。

24. 根据权利要求 23 的方法，所述植物繁殖材料为种子、幼苗根或幼苗新枝。

25. 根据权利要求 23 或 24 的方法，其中式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物以 100mg 至 10kg 每 100kg 种子的量施用。

26. 根据权利要求 23 或 24 的方法，其中所获得的植物根部和新枝得以保护。

27. 根据权利要求 1 至 18 任一项中所定义的式 I 化合物或其农业上有用盐的用途，其以 0.1g 至 10kg 每 100kg 种子的量处理种子。

28. 非治疗目的地用于处理、防除、防止或保护动物以对抗寄生虫侵染或感染的方法，包括向动物局部施用有效量的如权利要求 1 至 18 任一项中所定义的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物或包含其中至少一种化合物的组合物。

29. 根据权利要求 28 的方法，其中动物不是人类。

30. 根据权利要求 28 的方法，其中抗击来自双翅目 (Diptera)，蚤目 (Siphonaptera)，虱目 (Phthiraptera) 和蜱螨目 (Acarina) 的寄生虫。

31. 根据权利要求 28 的方法，其中抗击蚊、蝇、蚤和 / 或蜱。

32. 根据权利要求 28 的方法，其中所述动物是家畜。

33. 根据权利要求 32 的方法，其中所述动物是猫、狗。

34. 根据权利要求 28 的方法，其中所述动物是绵羊、牛、马、猪或鸡。

35. 如权利要求 1 至 18 的任一项中所定义的式 I 化合物用于制备经口、局部或肠胃外可应用或可给予的兽医药物的用途，所述药物用于处理、防除、防止或保护动物以对抗寄生虫侵染或感染。

36. 根据权利要求 35 的用途，其中动物不是人类。

37. 根据权利要求 35 的用途，其中抗击来自双翅目 (Diptera)，蚤目 (Siphonaptera)，虱目 (Phthiraptera) 和蜱螨目 (Acarina) 的寄生虫。

38. 根据权利要求 35 的用途，其中抗击蚊、蝇、蚤和 / 或蜱。

39. 根据权利要求 35 的用途，其中抗击内寄生虫。

40. 根据权利要求 39 的用途，其中所述内寄生虫是线虫类，绦虫，吸虫，和原生动物。

41. 根据权利要求 35 的用途，其中所述动物是家畜。

42. 根据权利要求 41 的用途，其中所述动物是猫、狗。

43. 根据权利要求 35 的用途，其中所述动物是绵羊、牛、马、猪或鸡。

44. 如权利要求 1 至 18 的任一项中所定义的式 I 化合物在制备药物中的用途，所述药物用于处理、防除、防止或保护动物以对抗寄生虫侵染或感染。

杀虫的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物及其使用方法

[0001] 交叉引用相关申请

[0002] 本申请要求 2009 年 7 月 30 日提交的美国临时专利申请号 61/229,769 的优先权的权益，通过引用将其全部并入本文。

发明领域

[0003] 本发明涉及新的杀虫和杀寄生虫 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，包含所述化合物的组合物，及其新的使用方法。

[0004] 发明背景

[0005] 动物害虫毁坏生长中的和已收获的农作物并攻击木质住房和商业建筑，导致食品供给和财产的重大经济损失。虽然已知大量杀虫剂，由于靶标害虫针对所述杀虫剂发展出抗性的能力，持续不断地需要对抗动物害虫的新试剂。特别是，动物害虫如昆虫类和螨类是难以有效防除的。

[0006] 噻吩并嘧啶类是已知的和已经描述于先有技术。在 EP-A 0370704 和 US 5,141,941 已经提及 4- 氨基 - 噻吩并嘧啶类用作具杀菌性质的芳烷基胺衍生物，而 EP 424125 中还描述了芳烷基胺衍生物的杀真菌用途。4- 氨基 - 噻吩并嘧啶衍生物组合物也已经描述于 DE-A 2654090 和 US 4,146,716，用于防除真菌、病毒和细菌性植物疾病和昆虫损害。在 EP-A 0452002 中公开了 N- 经取代的 - 噻吩并嘧啶 -4- 胺类，其具有杀真菌、杀昆虫和杀疥螨效用。JP-A 2004-238380 描述了 4- 苯基乙基氨基嘧啶的制备及其用作杀虫剂的用途。具有杀真菌活性的噻吩并嘧啶化合物已描述于 WO 2006/047397 和 US 2006/0089370A1 和 WO2007/046809。烷氧基化的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物已描述 WO 2007/135029 和 US 2009/0203524A1。具有除草、生长调节和杀昆虫活性的 N- 经取代的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物已经描述于 EP-A 0447891。通过引用将上文引用的公开内容各自全部并入本文。

[0007] 将本文引用的任意公开的申请和专利以及其中或在其申请过程中引用的全部文献（“申请引用文献”），和文献引用的申请中引用或提及的全部文献以及本文引用的或提及的全部文献（“本文引用文献”），和本文引用的文献中引用的或提及的全部文献，以及本文或本文通过援引并入的任意文献中提及的任意产品的任意生产商的指南、说明、产品说明书和产品说明页，在此通过引用并入本文并且可以用于实施本发明。

[0008] 本申请中对任意文献的引用或指明并非承认此种文献是本发明的先有技术。

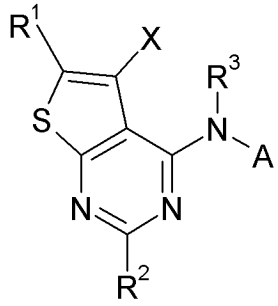
[0009] 尽管某些具杀昆虫活性的噻吩并嘧啶类已有报告，仍持续地需要具改良的杀虫和杀寄生虫活性的化合物，特别是对抗螨类的化合物。

[0010] 因此，本发明的主题是提供具有良好杀虫活性的方法和化合物，特别是对抗难以防除的昆虫类和螨类的方法和化合物。

发明概要

[0011] 已发现本发明主题通过新的通式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶衍生物得以解决 :

[0012]



式 I

[0013] 其中变量 X,A,R^1,R^2和 R^3描述如下,或其制药可接受的盐。在一种实施方式中,本发明提供农业和兽医组合物,其包含有效量的至少一种式 I 化合物或其对映体、非对映异构体或盐,以及农业上可接受的或兽医学可接受的载体。

[0014] 在另一实施方式中,本发明提供农业的或兽医组合物,其包含至少一种式 I 化合物,以及其它杀虫或杀寄生虫活性试剂和农业上可接受的或兽医学可接受的载体。

[0015] 在另一实施方式中,本发明提供用式 I 化合物或包含所述化合物的组合物来对抗或防除动物害虫、保护农作物或保护植物繁殖材料的方法和用途,包括将农作物,植物繁殖材料或动物害虫、它们的生境、繁殖场,其中所述动物害虫生长或可以生长的食品供给、植物、种子、土壤、区域、材料或环境,或者欲保护以免于动物害虫攻击或侵染的材料、植物、种子、土壤、表面或空间与杀虫有效量的至少一种式 I 化合物或其对映体、非对映异构体或盐进行接触。

[0016] 本发明还提供对抗动物体内或体表寄生虫的方法和用途,处理、防除或防止动物上的寄生物感染或侵染的方法和用途,包括将杀寄生虫有效量的至少一种式 I 化合物或包含该化合物的组合物,或其对映体、非对映异构体或兽医学可接受的盐,施用至动物。

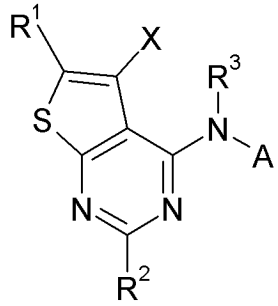
[0017] 应注意,在本公开中且特别在权利要求和 / 或段落中,术语如“包含”、“包括”、“含有”等可以具有美国专利法所赋予其的含义 ;例如,它们可以意指“包括”、“含有”、“包括”等 ;并且术语如“基本上由……组成”和“基本由……组成”具有美国专利法所赋予其的含义,例如,它们允许并未明确描述的元素,但排除先有技术中发现的或影响本发明基本或新特征的元素。

[0018] 这些和其它实施方式由以下详述部分所公开或所教导且涵盖。

[0019] 发明详述

[0020] 本发明提供新的和创造性的通式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d] 嘧啶衍生物 :

[0021]



式 I

[0022] 其中

[0023] X 选自卤素，C_1-C_{10}- 烷基或 C_1-C_{10}- 卤烷基；

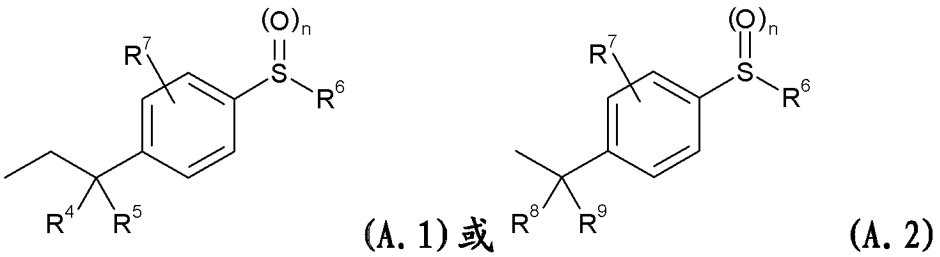
[0024] R^1选自下组：氢，卤素，甲酰基，C_1-C_{10}- 烷基，C_1-C_{10}- 烯基，C_1-C_{10}炔基，C_1-C_{10}- 卤烷基，C_1-C_{10}- 卤烯基，C_1-C_{10}- 卤炔基，C_1-C_{10}- 烷氧基，C_1-C_6- 烷氧基 -C_1-C_6- 烷基，C_1-C_{10}- 卤烷氧基，C_1-C_{10}- 烷硫基，C_1-C_{10}- 卤烷硫基，C_1-C_{10}- 烷亚硫酰基，C_1-C_{10}- 卤烷亚硫酰基，C_1-C_{10}- 烷磺酰基，C_1-C_{10}- 卤烷基 - 磺酰基，C_1-C_{10}- 烷氨基，C_1-C_{10}- 卤烷氨基，二 (C_1-C_{10}- 烷基）氨基，二 (C_1-C_{10})- 卤烷氨基，CN，$-CR^3=NOH$，$-CR^3=NOCH_3$和 $-CR^3=NOC_2H_5$；

[0025] R^2选自下组：氢，卤素，C_1-C_{10}- 烷基，C_1-C_{10}- 卤烷基，C_1-C_{10}- 烷氧基，C_1-C_6- 烷氧基 -C_1-C_6- 烷基，C_1-C_{10}- 卤烷氧基，C_1-C_{10}- 烷硫基，C_1-C_{10}- 卤烷硫基，C_1-C_{10}- 烷亚硫酰基，C_1-C_{10}- 卤烷亚硫酰基，C_1-C_{10}- 烷磺酰基，C_1-C_{10}- 卤烷基 - 磺酰基，C_1-C_{10}- 烷氨基，C_1-C_{10}- 卤烷氨基，二 (C_1-C_{10}- 烷基）氨基和二 (C_1-C_{10})- 卤烷氨基；

[0026] R^3选自氢，C_1-C_{10}- 烷基或 C_1-C_{10}- 卤烷基；

[0027] A 是

[0028]



[0029] 其中

[0030] n 是 0、1 或 2；

[0031] R^4，R^5，R^8和 R^9相互独立地选自氢，CN，C_1-C_{10}- 烷基或 C_1-C_{10}- 卤烷基；

[0032] R^6选自下组：C_1-C_{10}氟卤烷基，C_2-C_{10}氟卤烯基，C_2-C_{10}氟卤炔基和 C_3-C_7氟卤环烷基，其中前述氟卤烷基残基的碳原子可以进一步用 C_1-C_{10}- 烷氧基，C_1-C_{10}- 卤烷氧基，氰基和 $(C=O)R^q$取代，并且其中

[0033] R^q选自下组：氨基，C_1-C_6- 烷氧基，C_1-C_6- 卤烷氧基，C_1-C_6- 烷氨基，C_1-C_6- 卤烷氨基，二 (C_1-C_6- 烷基）氨基和二 (C_1-C_6)- 卤烷氨基；

[0034] R^7选自下组：氢，卤素，CN，C_1-C_{10}- 烷基，C_1-C_{10}- 卤烷基，C_1-C_{10}- 烷氧基，C_1-C_6- 烷氧基 -C_1-C_6- 烷基，C_1-C_{10}- 卤烷氧基，C_1-C_{10}- 烷硫基和 C_1-C_{10}- 卤烷硫基；

[0035] 和 / 或至少其对映体、非对映异构体或农业上或兽医学上可接受的盐。

[0036] 取决于取代形式，本发明所述化合物可包含一个或多个手性中心，在此情况下它们作为对映体或非对映异构体混合物存在。本发明的主题不仅是含有这些混合物的组合物，而且也是含有纯对映异构体或非对映异构体的那些。

[0037] 本发明所述化合物还可以以用于本发明用途的不同的晶体变型存在，并且还可以具有不同的生物活性。这些不同的晶体变型也是本发明的主题。

[0038] 另外，本发明的化合物可以作为水合物或溶剂合物存在，其中特定化学计量的量的水或溶剂在晶型中与分子相结合。式 I 化合物的水合物和溶剂合物也是本发明的主题。

[0039] 本发明涉及施用此种化合物来杀昆虫和杀寄生虫的方法，并且包括以下实施方式：

[0040] - 农业和兽医组合物，其包含一定量的至少一种式 I 化合物或其对映体、非对映异构体或盐；

[0041] - 将式 I 化合物或其对映体、非对映异构体或盐用于对抗或防除动物害虫；

[0042] - 对抗动物害虫的方法，其包括将动物害虫、它们生境、繁殖场，其中所述动物害虫正在生长或可以生长的食品供给、植物、种子、土壤、区域、材料或环境，或者欲保护以免于动物害虫攻击或侵染的材料、植物、种子、土壤、表面或空间与杀虫有效量的至少一种式 I 化合物或其对映体、非对映异构体或盐相接触；

[0043] - 保护农作物免于动物害虫攻击或侵染的方法，其包括将农作物与杀虫有效量的至少一种式 I 化合物或其对映体、非对映异构体或盐相接触；

[0044] - 保护植物繁殖材料特别是种子免于土壤昆虫类侵袭和保护幼苗根部和新枝免于土壤和叶面昆虫类侵袭的方法，包括在播种之前和 / 或在催芽之后将植物繁殖材料特别是种子与至少一种式 I 化合物或其对映异构体、非对映异构体或盐相接触；

[0045] - 含有式 I 化合物或其对映体、非对映异构体或盐的种子；

[0046] - 式 I 化合物或其对映异构体、非对映异构体或兽医学可接受的盐用于对抗动物体内和体表寄生虫的用途；

[0047] - 式 I 化合物或其对映异构体、非对映异构体或兽医学可接受的盐在制备对抗动物体内和体表寄生虫的药物的用途；

[0048] - 用于处理、防除、防止或保护动物对抗寄生虫侵染或感染的方法，其包括经口、局部或肠胃外向动物施用或给予杀寄生虫有效量的式 I 化合物或其对映异构体，非对映异构体和 / 或兽医学可接受的盐；

[0049] - 制备用于处理、防除、防止或保护动物对抗寄生虫侵染或感染的组合物的方法，其包含杀寄生虫有效量的式 I 化合物或其对映异构体，非对映异构体和 / 或兽医学可接受的盐。

[0050] 与公开于 WO 2006/047397 包含未经取代的硫代烷基取代基的那些化合物相比，本发明的氟卤化的硫代烷基取代的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物显示令人惊奇地更好的杀昆虫活性。它们还显示比 WO 2007/135029 烷氧基化的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物更好的效力。

[0051] 式 I 化合物及其农业上或兽医学可接受的盐高活性地对抗动物害虫，即有害节肢动物和线虫类，特别是对抗难以防除的昆虫类和螨类。

[0052] 此外，式 I 化合物的盐优选是农业上或兽医学可接受的盐。它们能够形成于常规方法中，例如，如果式 I 化合物具有碱性官能则通过将化合物与有关阴离子的酸进行反应，或者将式 I 的酸式化合物与适宜的碱进行反应。

[0053] 有用盐特别是那些阳离子的盐或那些酸的酸加成盐，其阳离子和阴离子分别不具有对根据本发明的所述化合物的作用的任意不利效果。适宜的阳离子特别是碱金属元素优选锂、钠和钾的离子，碱土金属优选钙、镁和钡的例子，和过渡金属元素优选锰、铜、锌和铁的离子，以及铵 (NH_4^+) 和经取代的铵，其中氢原子中一至四个用 C_1-C_4- 烷基，C_1-C_4- 羟基烷基，C_1-C_4- 烷氧基，C_1-C_4- 烷氧基 -C_1-C_4- 烷基，羟基 -C_1-C_4- 烷氧基 -C_1-C_4- 烷基，苯基或苄基替换。经取代的铵离子的实例包含甲基铵，异丙基铵，二甲基铵，二异丙基铵，三甲基铵，四甲基铵，四乙基铵，四丁基铵，2- 羟基乙基铵，2-(2- 羟基乙氧基) 乙基 - 铵，双 (2- 羟基

乙基）铵，苄基三甲基铵和苄基三乙基铵，以及磷鎓离子，锍离子，优选三（C_1-C_4-烷基）锍，和氧化锍离子，优选三（C_1-C_4-烷基）氧化锍。

[0054] 有用酸加成盐的阴离子主要是氯阴离子，溴阴离子，氟阴离子，氢硫酸阴离子，硫酸阴离子，二氢磷酸阴离子，氢磷酸阴离子，磷酸阴离子，硝酸阴离子，碳酸氢根阴离子，碳酸阴离子，六氟硅酸阴离子，六氟磷酸阴离子，苯甲酸阴离子，和 C_1-C_4- 链烷酸阴离子，优选甲酸阴离子，乙酸阴离子，丙酸阴离子和丁酸阴离子。它们能够通过将式 I 化合物与相应阴离子的酸优选盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸或硝酸反应而形成。

[0055] 本文所用术语具有它们在本领域中的常规含义，除非另有指定。在上述式 I 的定义中，所述取代基具有以下含义：

[0056] 在以上变量定义中提及的有机部分是，比如术语卤素，单独基团成员的单独列表的集合术语。前缀 C_n-C_m 在各情况下指所述基团中可能的碳原子数。

[0057] 术语卤素在各情况下表示氟、溴、氯或碘。在本发明的一种实施方式中，卤素是氟或氯。

[0058] 术语“C_1-C_{10}- 烷基”如本文所用以及烷氨基和二烷基氨基的烷基部分是指包括那些分别具有 1 至 10 个碳原子，1 至 6 个碳原子和 1 至 4 碳基团的饱和直链或支化的烃基团。C_1-C_{10} 烷基的实例包括但不限于，甲基，乙基，丙基，1- 甲基乙基，丁基，1- 甲基丙基，2- 甲基丙基，1,1- 二甲基乙基，戊基，1- 甲基丁基，2- 甲基丁基，3- 甲基丁基，2,2- 二甲基丙基，1- 乙基丙基，己基，1,1- 二甲基丙基，1,2- 二甲基丙基，1- 甲基戊基，2- 甲基戊基，3- 甲基戊基，4- 甲基戊基，1,1- 二甲基丁基，1,2- 二甲基丁基，1,3- 二甲基丁基，2,2- 二甲基丁基，2,3- 二甲基丁基，3,3- 二甲基丁基，1- 乙基丁基，2- 乙基丁基，1,1,2- 三甲基丙基，1,2,2- 三甲基丙基，1- 乙基 -1- 甲基丙基，1- 乙基 -2- 甲基丙基，庚基，辛基，2- 乙基己基，壬基和癸基及其异构体。C_1-C_4- 烷基意指例如甲基，乙基，丙基，1- 甲基乙基，丁基，1- 甲基丙基，2- 甲基丙基或 1,1- 二甲基乙基。

[0059] 术语“C_1-C_{10}- 卤烷基”如本文所用是指具有 1 至 10 个碳原子的直链或支化的饱和的烷基基团（如上所提及的），其中这些基团中的氢原子中的某些或全部可以用如上所提及的卤素原子替换。例如 C_1-C_4- 卤烷基包括，但不限于，氯甲基，溴甲基，二氯甲基，三氯甲基，氟甲基，二氟甲基，三氟甲基，氯氟甲基，二氯氟甲基，氯二氟甲基，1- 氯乙基，1- 溴乙基，1- 氟乙基，2- 氟乙基，2,2- 二氟乙基，2,2,2- 三氟乙基，2- 氯 -2- 氟乙基，2- 氯 -2,2- 二氟乙基，2,2- 二氯 -2- 氟乙基，2,2,2- 三氯乙基，五氟乙基等。

[0060] 术语“C_1-C_2- 氟烷基”如本文所用是指携带 1、2、3、4 或 5 氟原子的 C_1-C_2- 烷基，例如二氟甲基，三氟甲基，1- 氟乙基，2- 氟乙基，2,2- 二氟乙基，2,2,2- 三氟乙基，1,1,2,2- 四氟乙基或五氟乙基。

[0061] 术语“C_1-C_{10}- 氟卤烷基”如本文所用是指具有 1 至 10 个碳原子的直链或支化的饱和的烷基基团（如上所提及的），其携带至少一个氟原子，并且其中这些基团中的剩余氢原子中的某些或全部可以用独立选自氟、溴、氯或碘的卤素原子替换。

[0062] 术语“C_1-C_{10}- 烷氧基”如本文所用是指具有 1 至 10 个碳原子的直链或支化的饱和的烷基基团（如上所提及的），其通过氧原子连接。实例包括 C_1-C_6- 烷氧基，如甲氧基，乙氧基，OCH_2-C_2H_5，$OCH(CH_3)_2$，n- 丁氧基，$OCH(CH_3)$-C_2H_5，OCH_2-$CH(CH_3)_2$，$OC(CH_3)_3$，n- 戊氧基，1- 甲基丁氧基，2- 甲基丁氧基，3- 甲基丁氧基，1,1- 二甲基丙氧基，1,2- 二甲基丙氧基，2，

2- 二甲基 - 丙氧基，1- 乙基丙氧基，n- 己氧基，1- 甲基戊氧基，2- 甲基戊氧基，3- 甲基戊氧基，4- 甲基戊氧基，1，1- 二甲基丁氧基，1，2- 二甲基丁氧基，1，3- 二甲基丁氧基，2，2- 二甲基丁氧基，2，3- 二甲基丁氧基，3，3- 二甲基丁氧基，1- 乙基丁氧基，2- 乙基丁氧基，1，1，2- 三甲基丙氧基，1，2，2- 三甲基丙氧基，1- 乙基 -1- 甲基丙氧基，1- 乙基 -2- 甲基丙氧基等。

[0063] 术语“C_1-C_{10}- 卤烷氧基”如本文所用是指如上所提及的 C_1-C_{10}- 烷氧基基团，其部分或完全用氟、氯、溴和 / 或碘取代，即例如 C_1-C_6- 卤烷氧基，如氯甲氧基，二氯甲氧基，三氯甲氧基，氟甲氧基，二氟甲氧基，三氟甲氧基，氯氟甲氧基，二氯氟甲氧基，氯代二氟甲氧基，2- 氟乙氧基，2- 氯乙氧基，2- 溴乙氧基，2- 碘乙氧基，2，2- 二氟乙氧基，2，2，2- 三氟乙氧基，2- 氯 -2- 氟乙氧基，2- 氯 -2，2- 二氟乙氧基，2，2- 二氯 -2- 氟乙氧基，2，2，2- 三氯乙氧基，五氟乙氧基，2- 氟丙氧基，3- 氟丙氧基，2，2- 二氟丙氧基，2，3- 二氟丙氧基，2- 氯丙氧基，3- 氯丙氧基，2，3- 二氯丙氧基，2- 溴丙氧基，3- 溴丙氧基，3，3，3- 三氟丙氧基，3，3，3- 三氯丙氧基，2，2，3，3，3- 五氟丙氧基，七氟丙氧基，1-（氟甲基）-2- 氟乙氧基，1-（氯甲基）-2- 氯乙氧基，1-（溴甲基）-2- 溴乙氧基，4- 氟丁氧基，4- 氯丁氧基，4- 溴丁氧基，九氟丁氧基，5- 氟 -1- 戊氧基，5- 氯 -1- 戊氧基，5- 溴 -1- 戊氧基，5- 碘 -1- 戊氧基，5，5，5- 三氯 -1- 戊氧基，十一氟戊氧基，6- 氟 -1- 己氧基，6- 氯 -1- 己氧基，6- 溴 -1- 己氧基，6- 碘 -1- 己氧基，6，6，6- 三氯 -1- 己氧基或十二氟己氧基。在本发明的一种实施方式中，“C_1-C_{10}- 卤烷氧基”选自下组 ：氯甲氧基，氟甲氧基，二氟甲氧基，三氟甲氧基，2- 氟乙氧基，2- 氯乙氧基和 2，2，2- 三氟乙氧基。

[0064] 术语“C_1-C_6- 烷氧基 -C_1-C_6- 烷基”如本文所用是指经如上所提及的 C_1-C_6- 烷氧基取代的 C_1-C_6- 烷基，即例如，CH_2-OCH_3，CH_2-OC_2H_5，n- 丙氧基甲基，CH_2-$OCH(CH_3)_2$，n- 丁氧基甲基，（1- 甲基丙氧基）甲基，（2- 甲基丙氧基）甲基，CH_2-$OC(CH_3)_3$，2-（甲氧基）乙基，2-（乙氧基）乙基，2-(n- 丙氧基）乙基，2-(1- 甲基乙氧基）乙基，2-(n- 丁氧基）乙基，2-(1- 甲基丙氧基）乙基，2-(2- 甲基丙氧基）乙基，2-(1，1- 二甲基乙氧基）乙基，2-（甲氧基）丙基，2-（乙氧基）丙基，2-(n- 丙氧基）丙基，2-(1- 甲基乙氧基）丙基，2-(n- 丁氧基）丙基，2-(1- 甲基丙氧基）丙基，2-(2- 甲基丙氧基）丙基，2-(1，1- 二甲基乙氧基）丙基，3-（甲氧基）丙基，3-（乙氧基）丙基，3-(n- 丙氧基）丙基，3-(1- 甲基乙氧基）丙基，3-(n- 丁氧基）丙基，3-(1- 甲基丙氧基）丙基，3-(2- 甲基丙氧基）丙基，3-(1，1- 二甲基乙氧基）丙基，2-（甲氧基）丁基，2-（乙氧基）丁基，2-(n- 丙氧基）丁基，2-(1- 甲基乙氧基）丁基，2-(n- 丁氧基）丁基，2-(1- 甲基丙氧基）丁基，2-(2- 甲基丙氧基）丁基，2-(1，1- 二甲基乙氧基）丁基，3-（甲氧基）丁基，3-（乙氧基）丁基，3-(n- 丙氧基）丁基，3-(1- 甲基乙氧基）丁基，3-(n- 丁氧基）丁基，3-(1- 甲基丙氧基）丁基，3-(2- 甲基丙氧基）丁基，3-(1，1- 二甲基乙氧基）丁基，4-（甲氧基）丁基，4-（乙氧基）丁基，4-(n- 丙氧基）丁基，4-(1- 甲基乙氧基）丁基，4-(n- 丁氧基）丁基，4-(1- 甲基丙氧基）丁基，4-(2- 甲基丙氧基）丁基，4-(1，1- 二甲基乙氧基）丁基等。

[0065] 术语“C_1-C_6- 烷氧基 -C_1-C_6- 烷氧基”如本文所用是指经如上所提及的 C_1-C_6- 烷氧基取代的 C_1-C_6- 烷氧基，即例如，OCH_2-OCH_3，OCH_2-OC_2H_5，n- 丙氧基甲氧基，OCH_2-$OCH(CH_3)_2$，n- 丁氧基甲氧基，（1- 甲基丙氧基）甲氧基，（2- 甲基丙氧基）甲氧基，OCH_2-$OC(CH_3)_3$，2-（甲氧基）乙氧基，2-（乙氧基）乙氧基，2-(n- 丙氧基）乙氧基，2-(1- 甲基乙氧基）乙氧基，

2-(n-丁氧基)乙氧基,2-(1-甲基丙氧基)乙氧基,2-(2-甲基丙氧基)乙氧基,2-(1,1-二甲基乙氧基)乙氧基,2-(甲氧基)丙氧基,2-(乙氧基)丙氧基,2-(n-丙氧基)丙氧基,2-(1-甲基乙氧基)丙氧基,2-(n-丁氧基)丙氧基,2-(1-甲基丙氧基)丙氧基,2-(2-甲基丙氧基)丙氧基,2-(1,1-二甲基乙氧基)丙氧基,3-(甲氧基)丙氧基,3-(乙氧基)丙氧基,3-(n-丙氧基)丙氧基,3-(1-甲基乙氧基)丙氧基,3-(n-丁氧基)丙氧基,3-(1-甲基丙氧基)丙氧基,3-(2-甲基丙氧基)丙氧基,3-(1,1-二甲基乙氧基)丙氧基,2-(甲氧基)丁氧基,2-(乙氧基)丁氧基,2-(n-丙氧基)丁氧基,2-(1-甲基乙氧基)丁氧基,2-(n-丁氧基)丁氧基,2-(1-甲基丙氧基)丁氧基,2-(2-甲基丙氧基)丁氧基,2-(1,1-二甲基乙氧基)丁氧基,3-(甲氧基)丁氧基,3-(乙氧基)丁氧基,3-(n-丙氧基)丁氧基,3-(1-甲基乙氧基)丁氧基,3-(n-丁氧基)丁氧基,3-(1-甲基丙氧基)丁氧基,3-(2-甲基丙氧基)丁氧基,3-(1,1-二甲基乙氧基)丁氧基,4-(甲氧基)丁氧基,4-(乙氧基)丁氧基,4-(n-丙氧基)丁氧基,4-(1-甲基乙氧基)丁氧基,4-(n-丁氧基)丁氧基,4-(1-甲基丙氧基)丁氧基,4-(2-甲基丙氧基)丁氧基,4-(1,1-二甲基乙氧基)丁氧基等。

[0066] 术语“C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷氧基”如本文所用是指经如上所提及的C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷氧基取代的C_1-C_4-烷氧基,即例如,2-(2-甲氧基乙基氧基)乙基氧基,2-(2-乙氧基乙基氧基)乙基氧基。

[0067] 术语”C_1-C_{10}-烷基羰基”如本文所用是指具有1至10个碳原子(如上所提及的)的直链或支化的饱和的烷基基团,其经由在烷基基团中的任意键处的羰基基团的碳原子键合。实例包括C_1-C_6-烷基羰基如$CO-CH_3$,$CO-C_2H_5$,正丙基羰基,1-甲基乙基羰基,正-丁基羰基,1-甲基丙基羰基,2-甲基丙基羰基,1,1-二甲基乙基羰基,正-戊基羰基,1-甲基丁基羰基,2-甲基丁基羰基,3-甲基丁基羰基,1,1-二甲基丙基羰基,1,2-二甲基丙基羰基,2,2-二甲基丙基羰基,1-乙基丙基羰基,正-己基羰基,1-甲基戊基羰基,2-甲基戊基羰基,3-甲基戊基羰基,4-甲基戊基羰基,1,1-二甲基丁基羰基,1,2-二甲基丁基羰基,1,3-二甲基丁基羰基,2,2-二甲基丁基羰基,2,3-二甲基丁基羰基,3,3-二甲基丁基羰基,1-乙基丁基羰基,2-乙基丁基羰基,1,1,2-三甲基丙基羰基,1,2,2-三甲基丙基羰基,1-乙基-1-甲基丙基羰基或1-乙基-2-甲基丙基羰基等。

[0068] 术语“C_1-C_{10}-烷氧羰基”如本文所用是指具有1至10个碳原子的直链或支化的烷氧基基团(如上所提及的),其通过羰基基团的碳原子连接。实例包括(C_1-C_6-烷氧基)羰基,例如$CO-OCH_3$,$CO-OC_2H_5$,$COO-CH_2-C_2H_5$,$CO-OCH(CH_3)_2$,n-丁氧基羰基,$CO-OCH(CH_3)-C_2H_5$,$CO-OCH_2-CH(CH_3)_2$,$CO-OC(CH_3)_3$,n-戊氧基羰基,1-甲基丁氧基羰基,2-甲基丁氧基羰基,3-甲基丁氧基羰基,2,2-二甲基丙氧基羰基,1-乙基丙氧基羰基,n-己氧基羰基,1,1-二甲基丙氧基羰基,1,2-二甲基丙氧基羰基,1-甲基戊氧基羰基,2-甲基戊氧基羰基,3-甲基戊氧基羰基,4-甲基戊氧基羰基,1,1-二甲基丁氧基羰基,1,2-二甲基丁氧基羰基,1,3-二甲基丁氧基羰基,2,2-二甲基丁氧基羰基,2,3-二甲基丁氧基羰基,3,3-二甲基丁氧基羰基,1-乙基丁氧基羰基,2-乙基丁氧基羰基,1,1,2-三甲基丙氧基羰基,1,2,2-三甲基丙氧基羰基,1-乙基-1-甲基丙氧基羰基或1-乙基-2-甲基丙氧基羰基。

[0069] 术语“C_1-C_{10}-烷硫基(C_1-C_{10}-alkylsulfanyl:C_1-C_{10}-烷基-S-)”如本文所用是指具有1至10个碳原子的直链或支化的饱和的烷基基团(如上所提及的),其通过硫原子连接,例如C_1-C_4-烷硫基如甲硫基,乙基硫代,丙基硫代,1-甲基乙基硫代,丁基硫代,1-甲基

丙基硫代，2- 甲基丙基硫代或 1，1- 二甲基乙基硫代。

[0070] 术语“C_1-C_{10}- 烷亚硫酰基”(C_1-C_{10}- 烷基 -S(= O)-)，如本文所用是指具有 1 至 10 个碳原子的直链或支化的饱和的烃基团（如上所提及的），其通过烷基基团中任意键处的亚硫酰基基团的硫原子链接。实例包括 C_1-C_6- 烷亚硫酰基 :SO-CH_3，SO-C_2H_5，正丙基亚硫酰基，1- 甲基乙基亚硫酰基，正 - 丁基亚硫酰基，1- 甲基丙基亚硫酰基，2- 甲基丙基亚硫酰基，1，1- 二甲基乙基亚硫酰基，正 - 戊基亚硫酰基，1- 甲基丁基亚硫酰基，2- 甲基丁基亚硫酰基，3- 甲基丁基亚硫酰基，1，1- 二甲基丙基亚硫酰基，1，2- 二甲基丙基亚硫酰基，2，2- 二甲基丙基亚硫酰基，1- 乙基丙基亚硫酰基，正 - 己基亚硫酰基，1- 甲基戊基亚硫酰基，2- 甲基戊基亚硫酰基，3- 甲基戊基亚硫酰基，4- 甲基戊基亚硫酰基，1，1- 二甲基丁基亚硫酰基，1，2- 二甲基丁基亚硫酰基，1，3- 二甲基丁基亚硫酰基，2，2- 二甲基丁基亚硫酰基，2，3- 二甲基丁基亚硫酰基，3，3- 二甲基丁基亚硫酰基，1- 乙基丁基亚硫酰基，2- 乙基丁基亚硫酰基，1，1，2- 三甲基丙基亚硫酰基，1，2，2- 三甲基丙基亚硫酰基，1- 乙基 -1- 甲基丙基亚硫酰基或 1- 乙基 -2- 甲基丙基亚硫酰基。

[0071] 术语“C_1-C_{10}- 烷磺酰基”(C_1-C_{10}- 烷基 -S(= O)$_2$-) 如本文所用是指具有 1 至 10 个碳原子的直链或支化的饱和的烷基基团（如上所提及的），其经由烷基基团中任意键处的磺酰基基团的硫原子键合。实例包括 C_1-C_6- 烷磺酰基如 SO_2-CH_3，SO_2-C_2H_5，正丙基磺酰基，SO_2-$CH(CH_3)_2$，正 - 丁基磺酰基，1- 甲基丙基磺酰基，2- 甲基丙基磺酰基，SO_2-$C(CH_3)_3$，正 - 戊基磺酰基，1- 甲基丁基磺酰基，2- 甲基丁基磺酰基，3- 甲基丁基磺酰基，1，1- 二甲基丙基磺酰基，1，2- 二甲基丙基磺酰基，2，2- 二甲基丙基磺酰基，1- 乙基丙基磺酰基，正 - 己基磺酰基，1- 甲基戊基磺酰基，2- 甲基戊基磺酰基，3- 甲基戊基磺酰基，4- 甲基戊基磺酰基，1，1- 二甲基丁基磺酰基，1，2- 二甲基丁基磺酰基，1，3- 二甲基丁基磺酰基，2，2- 二甲基丁基磺酰基，2，3- 二甲基丁基磺酰基，3，3- 二甲基丁基磺酰基，1- 乙基丁基磺酰基，2- 乙基丁基磺酰基，1，1，2- 三甲基丙基磺酰基，1，2，2- 三甲基丙基磺酰基，1- 乙基 -1- 甲基丙基磺酰基或 1- 乙基 -2- 甲基丙基磺酰基等。

[0072] 术语“C_2-C_{10}- 烯基”如本文所用是指具有 2 至 10 个碳原子和任意位置的至少一个双键的直链或支化的不饱和的烃基团。“C_2-C_{10}- 烯基”基团可以在链中包括多于一个双键。实例包括但不限于，乙烯基，1- 丙烯基，2- 丙烯基，1- 甲基 - 乙烯基，1- 丁烯基，2- 丁烯基，3- 丁烯基，1- 甲基 -1- 丙烯基，2- 甲基 -1- 丙烯基，1- 甲基 -2- 丙烯基，2- 甲基 -2- 丙烯基；1- 戊烯基，2- 戊烯基，3- 戊烯基，4- 戊烯基，1- 甲基 -1- 丁烯基，2- 甲基 -1- 丁烯基，3- 甲基 -1- 丁烯基，1- 甲基 -2- 丁烯基，2- 甲基 -2- 丁烯基，3- 甲基 -2- 丁烯基，1- 甲基 -3- 丁烯基，2- 甲基 -3- 丁烯基，3- 甲基 -3- 丁烯基，1，1- 二甲基 -2- 丙烯基，1，2- 二甲基 -1- 丙烯基，1，2- 二甲基 -2- 丙烯基，1- 乙基 -1- 丙烯基，1- 乙基 -2- 丙烯基，1- 己烯基，2- 己烯基，3- 己烯基，4- 己烯基，5- 己烯基，1- 甲基 -1- 戊烯基，2- 甲基 -1- 戊烯基，3- 甲基 -1- 戊烯基，4- 甲基 -1- 戊烯基，1- 甲基 -2- 戊烯基，2- 甲基 -2- 戊烯基，3- 甲基 -2- 戊烯基，4- 甲基 -2- 戊烯基，1- 甲基 -3- 戊烯基，2- 甲基 -3- 戊烯基，3- 甲基 -3- 戊烯基，4- 甲基 -3- 戊烯基，1- 甲基 -4- 戊烯基，2- 甲基 -4- 戊烯基，3- 甲基 -4- 戊烯基，4- 甲基 -4- 戊烯基，1，1- 二甲基 -2- 丁烯基，1，1- 二甲基 -3- 丁烯基，1，2- 二甲基 -1- 丁烯基，1，2- 二甲基 -2- 丁烯基，1，2- 二甲基 -3- 丁烯基，1，3- 二甲基 -1- 丁烯基，1，3- 二甲基 -2- 丁烯基，1，3- 二甲基 -3- 丁烯基，2，2- 二甲基 -3- 丁烯基，2，3- 二甲基 -1- 丁烯基，2，3- 二甲基 -2- 丁烯基，

2,3- 二甲基 -3- 丁烯基,3,3- 二甲基 -1- 丁烯基,3,3- 二甲基 -2- 丁烯基,1- 乙基 -1- 丁烯基,1- 乙基 -2- 丁烯基,1- 乙基 -3- 丁烯基,2- 乙基 -1- 丁烯基,2- 乙基 -2- 丁烯基,2- 乙基 -3- 丁烯基,1,1,2- 三甲基 -2- 丙烯基,1- 乙基 -1- 甲基 -2- 丙烯基,1- 乙基 -2- 甲基 -1- 丙烯基和 1- 乙基 -2- 甲基 -2- 丙烯基。

[0073] 术语“C_2-C_{10}- 炔基”如本文所用是指具有 2 至 10 个碳原子且包含至少一个三重键的直链或支化的不饱和的烃基团,如乙炔基,丙 -1- 炔 -1- 基,丙 -2- 炔 -1- 基,n- 丁 -1- 炔 -1- 基,n- 丁 -1- 炔 -3- 基,n- 丁 -1- 炔 -4- 基,n- 丁 -2- 炔 -1- 基,n- 戊 -1- 炔 -1- 基,n- 戊 -1- 炔 -3- 基,n- 戊 -1- 炔 -4- 基,n- 戊 -1- 炔 -5- 基,n- 戊 -2- 炔 -1- 基,n- 戊 -2- 炔 -4- 基,n- 戊 -2- 炔 -5- 基,3- 甲基丁 -1- 炔 -3- 基、3- 甲基丁 -1- 炔 -4- 基、n- 己 -1- 炔 -1- 基、n- 己 -1- 炔 -3- 基、n- 己 -1- 炔 -4- 基、n- 己 -1- 炔 -5- 基、n- 己 -1- 炔 -6- 基、n- 己 -2- 炔 -1- 基、n- 己 -2- 炔 -4- 基、n- 己 -2- 炔 -5- 基、n- 己 -2- 炔 -6- 基、n- 己 -3- 炔 -1- 基、n- 己 -3- 炔 -2- 基、3- 甲基戊 -1- 炔 -1- 基、3- 甲基戊 -1- 炔 -3- 基、3- 甲基戊 -1- 炔 -4- 基、3- 甲基戊 -1- 炔 -5- 基、4- 甲基戊 -1- 炔 -1- 基、4- 甲基戊 -2- 炔 -4- 基或 4- 甲基戊 -2- 炔 -5- 基等。

[0074] 术语“C_2-C_{10}- 氟卤烯基”或“C_2-C_{10}- 氟卤炔基”如本文所用是指具有 2 至 10 个碳原子且分别包含至少一个双键、一个三重键的直链或支化的不饱和的烯基或炔基基团(如上所提及的),其携带至少一个氟原子,且其中这些基团中剩余氢原子中的某些或全部可以用相互独立选自氟、溴、氯或碘的卤素原子替换。

[0075] 术语“C_3-C_{10}- 环烷基”如本文所用是指具有 3 至 10 个碳原子,特别是 3 至 8 个碳原子的单环烃残基,例如环丙基,环丁基,环戊基,环己基,环庚基,环辛基,环壬基或环癸基。

[0076] 术语“C_3-C_{10}- 氟卤环烷基”如本文所用是指具有 3 至 10 个碳原子的单环烃残基,其携带至少一个氟原子,且其中这些基团中剩余氢原子中的某些或全部可以用相互独立选自氟、溴、氯或碘的卤素原子替换。

[0077] 术语“部分或完全卤化的”意指给定残基中氢原子中的 1 个或更多个,例如 1 个、2 个、3 个、4 个或 5 个或全部已经用卤素原子特别是氟或氯替换。

[0078] 关于根据本发明的不同使用方法,特别优选的是式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物的取代基和变量的在各情况下单独或组合的以下含义:

[0079] 优选的是式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物,其中 A 是 A2 而 R^9 选自下组:氢,C_1-C_{10}- 烷基或 C_1-C_{10}- 卤烷基。

[0080] 更优选的是式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物,其中 A 是 A2,R^8 为氢而 R^9 是 C_1-C_{10}- 烷基或 C_1-C_{10}- 卤烷基。

[0081] 特别优选的是那些式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物,其中 A 是 A2,R^8 为氢而 R^9 是 C_1-C_{10}- 烷基或 C_1-C_{10}- 卤烷基,并且其中 R_8 和 R^9 结合至的手性碳原子处的取代基为 (S)- 构型。

[0082] 最优选的是式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物,其中 A 是 A2,R^8 为氢而 R^9 为甲基。

[0083] 特别优选的是那些式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物,其中 A 是 A2,R^8 为氢而 R^9 为甲基,并且其中 R^8 和 R^9 结合至的手性碳原子处的取代基为 (S)- 构型。

[0084] 优选的是式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物,其中 R^7 为氢。

[0085] 优选的是式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中 R^6 是 C_1-C_{10}- 氟卤烷基。

[0086] 更优选的是式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中 R^6 是三氟甲基。

[0087] 优选的是式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中 R^3 为氢。

[0088] 优选的是式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中 R^2 选自下组 ：氢，卤素，C_1-C_{10}- 烷基和 C_1-C_{10}- 卤烷基。

[0089] 更优选的是式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中 R^2 为氢。

[0090] 优选的是式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中 R^1 选自下组 ：氢，卤素，C_1-C_{10}- 烷基和 C_1-C_{10}- 卤烷基。

[0091] 更优选的是式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中 R^1 为氢或氯。

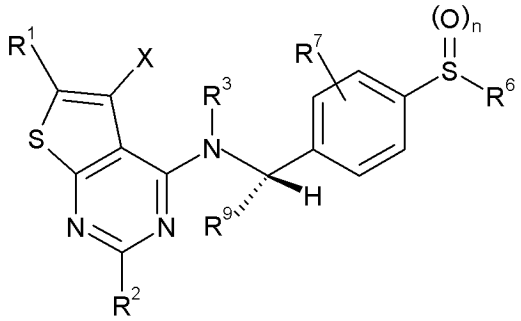
[0092] 优选的是式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中 X 是卤素。

[0093] 更优选的是式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中 X 是氯。

[0094] 优选的是式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中 n 是 0。

[0095] 特别优选的是 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶所述通式 I-S 化合物 ：

[0096]



(式 I-S)

[0097] 其中 n，X，R^1，R^2，R^3，R^6，R^7 和 R^9 如对式 I 所定义。

[0098] 更优选的是通式 I-S 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中 X，R^1，R^2，R^3，R^6，R^7 和 R^9 代表单独或组合的上文对式 I 定义的优选取代基。

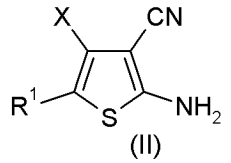
[0099] 最优选的是通式 I-S 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d]- 嘧啶化合物，其中 n 是 0 或 1，X 是氯，R^1 为氢或卤素，R^2，R^3 和 R^7 是氢，R^6 是 C_1-C_{10}- 氟卤烷基和 R^9 是 C_1-C_{10}- 烷基或 C_1-C_{10}- 卤烷基。

[0100] 制备方法

[0101] 根据本发明的式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d] 嘧啶化合物能够如涉及 EP 0447891B 的 WO 2007/135029 中的描述制备，其中 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d] 嘧啶化合物起始自噻吩化合物 (II) 进行制备。

[0102] 在过量磷酰卤存在下，例如 2 至 20mol 磷酰氯或磷酰溴比 1mol(II)，将式 (II) 噻吩衍生物

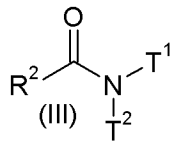
[0103]



(II)

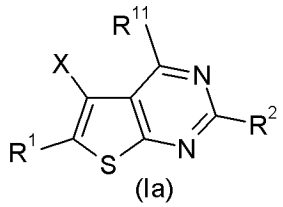
[0104] 其中 X 和 R^1 如上文所定义，与二烷基酰胺 (III) 反应

[0105]



[0106] 其中 T^1 和 T^2 相互独立地是 C_1-C_4- 烷基或与氮一起形成 5 至 7- 元饱和的杂环而 R^2 如上文所定义，提供式 (Ia) 的噻吩并 -(2,3-d)- 嘧啶衍生物

[0107]



[0108] 其中 R^{11} 是氯或溴。

[0109] 如上所述获得的式 (Ia) 化合物能够根据已知的方法通过其它亲核残基取代 4 位卤素原子进行转化，所述方法如描述于 ' The Chemistry of Heterocyclic compounds' ," The pyrimidines" ,D.J.Brown 编著，J.Wiley & Sony,New York,London, Vol.16,(1962) ;Vol.16,Suppl.1,Vol.16,Suppl.2(1985)。

[0110] 通过如 EP-A 447 891 描述用 NR^3A 取代 R^{11}，将它们转化为相应的式 I 化合物。

[0111] 适宜的二烷基 - 酰胺类 (III) 的实例是 N,N- 二甲基甲酰胺，N,N- 二甲基 - 乙酰胺，N,N- 二乙基甲酰胺，N,N- 二乙基乙酰胺，N,N- 二甲基丙酰胺和 N,N- 二甲基苯甲酸酰胺。

[0112] 如上所提及的，反应必须在与噻吩衍生物 (II) 相比过量的磷酰氯或磷酰溴存在下进行。有利地，反应可以用磷酰卤作溶剂而发生。优选地，每 mol 噻吩衍生物 (II) 使用 2 至 6mol 磷酰卤。

[0113] 一般地，噻吩衍生物 (II) 与 N,N- 二烷基酰胺 (III) 的摩尔浓度比是 1 ： 1 至 1 ： 5。

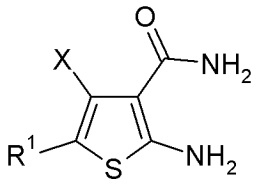
[0114] 反应通常在惰性溶剂中进行，如氯苯，硝基苯，苯甲酸甲酯，二氯甲烷，二氯苯，三氯苯，苯甲酸乙酯，氯仿，四氯化碳，上文所列的 N,N- 二烷基酰胺类之一，三氯乙烷，六甲替磷酰三胺 (HMPT) 或四氯乙烯。优选的溶剂是磷酰氯和磷酰溴或上文所列的 N,N- 二烷基酰胺类之一。

[0115] 反应在 20℃以上具有足够的反应速度。在 150℃以上的温度，反应特异性降低。优选地，反应在 50 至 110℃的温度进行。

[0116] 通过使用催化量的路易斯酸如氯化钾，氯化钠，氯化铁 (III)，氯化铝，氯化锌，氯化锡，五氟化锑，三氟化硼或四氯化钛或使用碱性的催化剂如 N,N- 二甲基苯胺或 N,N- 二乙基苯胺，能够实现增加收率和增强反应速度。

[0117] 还提供制备式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d] 嘧啶化合物的其它方法 :根据一般实践，将式 (IV) 化合物

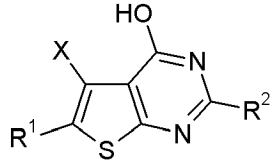
[0118]



(IV)

[0119] 其中 X 和 R^1 如上文所定义，与含有至少残基 R^2-CO- 的酸酐或羧酸 R^2-COOH，或羧酸和路易斯酸的加合物反应，其中 R^2 具有如上所述的各含义，得到式 (Ib) 化合物：

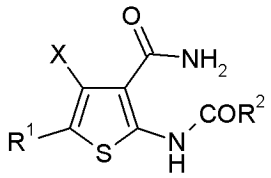
[0120]



(Ib)

[0121] 用磷酰卤将式 (Ib) 化合物转化为如上定义的式 (Ia) 化合物。在特定的情况下适宜的是以两步进行该转化，经此分离中间体式 (VI) 化合物：

[0122]



(VI)

[0123] 一般地，酸酐或加合物以相对化合物 (VI) 的 100 至 500mol-%，优选 100 至 300mol-%的量使用。

[0124] 包含至少一个残基 R^2-CO- 的羧酸酐，能够由二羧酸 R^2-COOH 如新戊酸、丙酸或乙酸提供；或者由一羧酸 R^2-COOH 和一氧代酸如磷酸或硫酸提供。

[0125] 优选的甲酸 R^2-COOH 是具有 1 至 4 个碳原子的那些，特别是甲酸和乙酸。

[0126] 另外，羧酸 R^2-COOH 和路易斯酸如氯化锌，三氟化硼和四氯化钛的加合物也是适宜的。

[0127] 有利地，自 (IV) 至 (Ib) 的转化在 (-10) 至 150℃，优选 20 至 120℃，更优选 80 至 120℃的温度，在惰性溶剂如 N，N- 二烷基酰胺类，优选地 N，N- 二甲基甲酰胺和 N，N- 二甲基乙酰胺，N- 甲基 - 吡咯烷酮，N，N- 二甲基丙烯脲或六甲替磷酰三胺中进行。

[0128] 为了分离中间体化合物 (VI)，反应温度应当选自 (-10) 至 80℃。

[0129] 一般地，应以相对羧酸酐，羧酸或羧酸 - 路易斯酸 - 加合物过量 1 至 10 倍、优选过量的 1 至 5 倍地加入碱如三乙基胺，N- 甲基 - 吡咯烷酮或 N，N- 二甲基苯胺。

[0130] 加水除去试剂，如二环己基碳二亚胺，或 Vilsmeier 试剂能够加速反应并增加式 (Ib) 化合物收率。

[0131] 式 (Ib) 化合物 4 位的羟基基团能够根据一般实践用氯或溴取代，例如用磷酰氯或磷酰溴。

[0132] 最终地，按例如 EP-A 447 891 的描述将 4 位氯和溴用 NR^3A 取代。

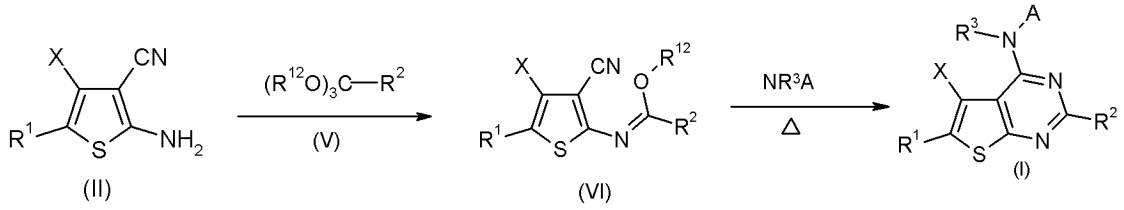
[0133] NR^3A 的经硫代取代的芳基基团 A 能够通过各苯硫酚与携带适宜离去基团例如卤素

原子的氟烷基化合物的烷化反应来制备。

[0134] 此外，根据图解 1，通过用其中 R^{12}是 C_1-C_4- 烷基的原酸酯 (V) 将式 (II) 噻吩化合物转化为式 (VI) 衍生物，随后在胺 NR^3A 存在下环化，能够获得根据本发明的式 (I) 噻吩并 [2,3-d] 嘧啶化合物。

[0135] 图解 1 ：

[0136]



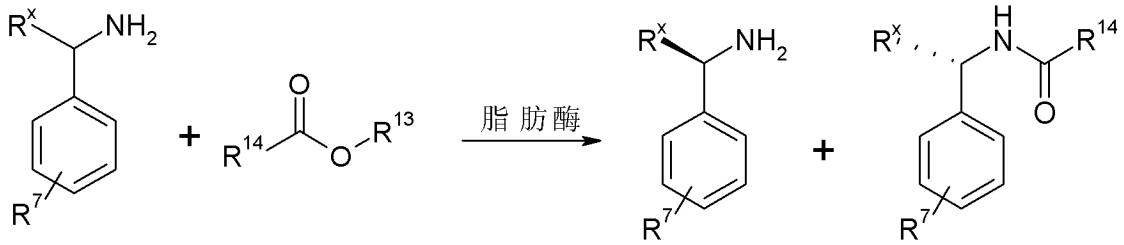
[0137] 最新描述的反应图解已知于 DE-A 26 54 090。噻吩衍生物 (II) 和 (IV) 能够根据公开于 EP-A1 0193 885 的教导获得。

[0138] 原则上，对映体富集的经取代的苄基胺类 NR^3A 能够通过拆分相应的外消旋体或自非手性前体经由不对称合成来获得。

[0139] Synthesis 2008,14,2283-2287 描述了典型程序，其中将脂肪酶用作外消旋的经取代的苄基胺类手性拆分的催化剂。根据以下图解 2，外消旋体会例如与小烷基或烯基（其中 R^{13}是例如 C_1-C_4- 烷基，C_1-C_4- 烯基和 R^{14}是例如任选取代的 C_1-C_4- 烷基如 CH_2OCH_3) 的脂族羧基酯类反应，而在完成反应之后，一种对映体会转化为相应的酰胺，而另一种对映体会保持未反应。

[0140] 图解 2 ：

[0141]

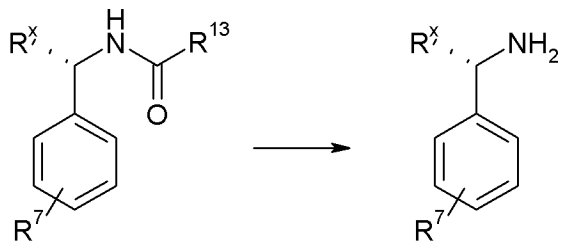


[0142] 其中 R^x如上文对 R^4，R^5，R^7或 R^8所定义。

[0143] 在 R^x是小烷基基团如甲基的情况下，典型地，(S)- 对映体会被酰基化而 (R)- 对映体会保持未反应。在例如经由蒸馏或色谱法分离所述反应混合物之后，(R)- 对映体可以直接使用，而在根据以下图解 3 水解之后在裂解酰胺键之后能获得 (S)- 对映体 ：

[0144] 图解 3 ：

[0145]

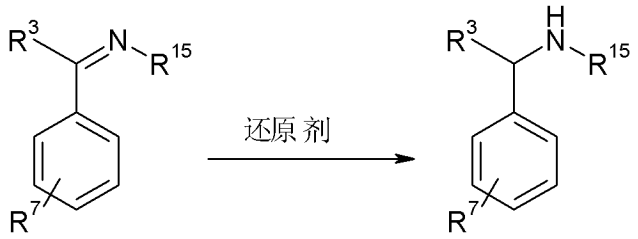


[0146] 经由不对称合成得到对映体富集的或对映体纯的经取代的苄基胺类的不同的合成程序描述于文献中。典型地，它们牵涉如图解 4 描述的 C ＝ N 键还原。该类型还原的适

当底物是肟醚类（例如 R^{15}= C_1-C_4- 烷氧基），如例如 Org. Lett. 2007, 9, 1793-1795 的描述，或者手性硫酰亚胺（例如 R^{15}= S(=O)tBu），如例如 J. Org. Chem. 2006, 71, 6859-6862 的描述。

[0147] 图解 4：

[0148]



[0149] 为了获得适于农业或兽医使用的盐，可在 0 至 150℃、优选 20 至 120℃的温度范围内将式 I 的 4- 氨基 - 噻吩并 [2,3-d] 嘧啶化合物与常规成盐剂反应，比如盐酸，氢溴酸，氢碘酸，硫酸，磷酸，甲酸，乙酸，草酸，苯磺酸，p- 甲苯 - 磺酸，十二烷基苯磺酸，溴甲烷，二甲基硫酸酯或二乙基硫酸酯。

[0150] 成盐通常在溶剂或稀释剂中进行。适宜的是例如脂族烃 n- 戊烷，n- 己烷或石油醚，芳族烃如苯、甲苯或二甲苯，苯炔或醚类如二乙醚、甲基 - 叔丁醚、四氢呋喃或二噁烷，以及酮类如丙酮、甲基乙基酮或甲基异丙基酮，以及卤化的烃如氯苯、二氯甲烷、氯乙烯，氯仿或四氯乙烯。也可以使用这些溶剂的混合物。

[0151] 为了制备式 I 化合物的盐，通常以化学计量比采用反应物。可以使用过量的一种或另一种组分。

[0152] 在描述的制备方法中，变量 X、R^1、R^2和 R^3具有如上定义的含义，特别是优选提及的含义。

[0153] 如果各个化合物不能经由上述途径制备，则能够通过其它化合物 I 的衍生化或通过所描述的合成途径的常规变型来制备它们。

[0154] 所述反应混合物以常规方式进行后处理，例如与水混合、分相，并且如果适当的，通过色谱法例如在矾土或硅胶上纯化粗制产品。某些中间体和终产品可以以无色或淡褐色粘稠油状物形式获得，其不含或已在减压且适度升高温度的下纯化除去挥发性组分。如果中间体和终产品作为固体获得，它们可以通过重结晶或浸提进行纯化。

[0155] 害虫

[0156] 式 I 化合物及其盐特别适于有效地防除节肢动物害虫如蛛形类、千足虫 (myriapedes) 和昆虫类以及线虫类。

[0157] 由式 I 化合物防除的动物害虫包括例如：

[0158] 鳞翅目 (Lepidoptera) 昆虫，例如 Agrotis ypsilon，黄地老虎 (Agrotis segetum)，Alabama argillacea，大豆夜蛾 (Anticarsia gemmatalis)，苹果银蛾 (Argyresthia conjugella)，Autographa gamma，松粉蝶尺蛾 (Bupalus piniarius)，Cacoecia murinana，Capua reticulana，果园秋尺蛾 (Cheimatobia brumata)，云杉色卷蛾 (Choristoneura fumiferana)，西部云杉色卷蛾 (Choristoneura occidentalis)，白点粘虫 (Cirphis unipuncta)，苹果皮小卷蛾 (Cydia pomonella)，Dendrolimus pini，Diaphania nitidalis，Diatraea grandiosella，埃及钻夜蛾 (Earias insulana)，南美

玉米苗斑螟(Elasmopalpus lignosellus),女贞细卷蛾(Eupoecilia ambiguella),欧松梢小卷蛾(Evetria bouliana),粒肤脏切夜蛾(Feltia subterranea),蜡螟(Galleria mellonella),李小食心虫(Grapholitha funebrana),梨小食心虫(Grapholitha molesta),棉铃虫(Heliothis armigera),烟芽夜蛾(Heliothis virescens),实夜蛾属(Heliothis)玉蜀黍属(Zea),菜心野螟(Hellula undalis),Hibernia defoliaria,美国白蛾(Hyphantria cunea),H小苹果巢蛾(Yponomeuta malinellus),番茄茎麦蛾(Keiferia lycopersicella),铁杉尺蛾(Lambdina fiscellaria),Laphygma exigua,Leucoptera coffeella,旋纹潜蛾(Leucoptera scitella),Lithocolletis blancardella,鲜食葡萄小卷蛾(Lobesia botrana),网锥额野螟(Loxostege sticticalis),舞毒蛾(Lymantria dispar),模毒蛾(Lymantria monacha),桃潜叶蛾(Lyonetia clerkella),黄褐天幕毛虫(Malacosoma neustria),甘蓝夜蛾(Mamestra brassicae),黄杉合毒蛾(Orgyia pseudotsugata),欧洲玉米螟(Ostrinia nubilalis),小眼夜蛾(Panolis flammea),棉红铃虫(Pectinophora gossypiella),疆夜蛾(Peridroma saucia),圆掌舟蛾(Phalera bucephala),马铃薯麦蛾(Phthorimaea operculella),柑橘叶潜蛾(Phyllocnistis citrella),欧洲粉蝶(Pieris brassicae),苜蓿绿夜蛾(Plathypena scabra),小菜蛾(Plutella xylostella),大豆尺夜蛾(Pseudoplusia includens),美松梢小卷蛾(Rhyacionia frustrana),Scrobipalpula absoluta,麦蛾(Sitotroga cerealella),葡萄长须卷蛾(Sparganothis pilleriana),草地夜蛾(Spodoptera frugiperda),棉贪夜蛾(Spodoptera littoralis),斜纹贪夜蛾(Spodoptera litura),Thaumatopoea pityocampa,栎绿卷蛾(Tortrix viridana),粉斑夜蛾(Trichoplusia ni)和云杉线小卷蛾(Zeiraphera canadensis);

[0159] 甲虫类(鞘翅目(Coleoptera)),例如梨窄吉丁(Agrilus sinuatus),直条叩甲(Agriotes lineatus),暗叩甲(Agriotes obscurus),Amphimallus solstitialis,北方材小蠹(Anisandrus dispar),棉铃象(Anthonomus grandis),伞花象(Anthonomus pomorum),Aphthona euphoridae,Athous haemorrhoidalis,甜菜隐食甲(Atomaria linearis),纵坑切梢小蠹(Blastophagus piniperda),Blitophaga undata,蚕豆象(Bruchus rufimanus),豌豆象(Bruchus pisorum),Bruchus lentis,桦绿卷象(Byctiscus betulae),甜菜大龟甲(Cassida nebulosa),菜豆萤叶甲(Cerotoma trifurcata),金花金龟(Cetonia aurata),白菜籽龟象(Ceuthorrhynchus assimilis),Ceuthorrhynchus napi,蚤凹胫跳甲(Chaetocnema tibialis),烟草叩甲(Conoderus vespertinus),石刁柏负泥虫(Crioceris asparagi),Ctenicera ssp.,Diabrotica longicornis,Diabrotica semipunctata,Diabrotica 12-punctata,Diabrotica speciosa,Diabrotica virgifera,Epilachna varivestis,烟草跳甲(Epitrix hirtipennis),巴西棉灰蒙象(Eutinobothrus brasiliensis),欧洲松树皮象(Hylobius abietis),埃及苜蓿叶象(Hypera brunneipennis),紫苜蓿叶象(Hypera postica),云杉八齿小蠹(Ips typographus),烟草负泥虫(Lema bilineata),Lema melanopus,马铃薯叶甲(Leptinotarsa decemlineata),甜菜叩甲(Limonius californicus),稻水象(Lissorhoptrus oryzophilus),Melanotus communis,Meligethes aeneus,大栗鳃金龟(Melolontha hippocastani),五月鳃金龟(Melolontha melolontha),水稻负泥虫(Oulema oryzae),黑葡萄耳象(Otiorrhynchus

sulcatus)，草莓根耳象 (Otiorrhynchus ovatus)，辣根猿叶甲 (Phaedon cochleariae)，梨树叶象 (Phyllobius pyri)，Phyllotreta chrysocephala，食叶鳃金龟属 (Phyllophaga sp.)，庭园发丽金龟 (Phyllopertha horticola)，绿胸菜跳甲 (Phyllotreta nemorum)，黄曲条菜跳甲 (Phyllotreta striolata)，日本弧丽金龟 (Popillia japonica)，直条根瘤象 (Sitona lineatus) 和谷象 (Sitophilus granaria)；

[0160] 蝇、蚊类 (双翅目 (Diptera))，例如埃及伊蚊 (Aedes aegypti)，白条伊蚊 (Aedes albopictus)，刺扰伊蚊 (Aedes vexans)，墨西哥按实蝇 (Anastrepha ludens)，五斑按蚊 (Anopheles maculipennis)，Anopheles crucians，Anopheles albimanus，冈比亚按蚊 (Anopheles gambiae)，Anopheles freeborni，Anopheles leucosphyrus，微小按蚊 (Anopheles minimus)，四斑按蚊 (Anopheles quadrimaculatus)，红头丽蝇 (Calliphora vicina)，地中海实蝇 (Ceratitis capitata)，蛆症金蝇 (Chrysomya bezziana)，Chrysomya hominivorax，Chrysomya macellaria，Chrysops discalis，Chrysops silacea，Chrysops atlanticus，嗜人锥蝇 (Cochliomyia hominivorax)，高粱康瘿蚊 (Contarinia sorghicola)，噬人瘤蝇 (Cordylobia anthropophaga)，Culicoides furens，尖音库蚊 (Culex pipiens)，Culex nigripalpus，致倦库蚊 (Culex quinquefasciatus)，Culex tarsalis，Culiseta inornata，Culiseta melanura，瓜寡鬃实蝇 (Dacus cucurbitae)，油橄榄果实蝇 (Dacus oleae)，油菜叶瘿蚊 (Dasineura brassicae)，葱地种蝇 (Delia antique)，麦地种蝇 (Delia coarctata)，灰地种蝇 (Delia platura)，甘蓝地种蝇 (Delia radicum)，人肤蝇 (Dermatobia hominis)，夏厕蝇 (Fannia canicularis)，三点尺禾蝇 (Geomyza tripunctata)，肠胃蝇 (Gasterophilus intestinalis)，刺舌蝇 (Glossina morsitans)，须舌蝇 (Glossina palpalis)，棕足舌蝇 (Glossina fuscipes)，拟寄舌蝇 (Glossina tachinoides)，西方角蝇 (Haematobia irritans)，鞍瘿蚊 (Haplodiplosis equestris)，Hippelates spp.，灰地种蝇 (Hylemyia platura)，Hypoderma lineata，Leptoconops torrens，蔬菜斑潜蝇 (Liriomyza sativae)，三叶草斑潜蝇 (Liriomyza trifolii)，Lucilia caprina，铜绿蝇 (Lucilia cuprina)，丝光绿蝇 (Lucilia sericata)，Lycoria pectoralis，Mansonia titillanus，小麦瘿蚊 (Mayetiola destructor)，秋家蝇 (Musca autumnalis)，家蝇 (Musca domestica)，厩腐蝇 (Muscina stabulans)，羊狂蝇 (Oestrus ovis)，禾蝇 (Opomyza florum)，瑞典麦秆蝇 (Oscinella frit)，波菜泉蝇 (Pegomya hysocyami)，Phorbia antiqua，萝卜地种蝇 (Phorbia brassicae)，Phorbia coarctata，Phlebotomus argentipes，Psorophora columbiae，胡萝卜茎蝇 (Psila rosae)，Psorophora discolor，Prosimulium mixtum，樱桃绕实蝇 (Rhagoletis cerasi)，苹绕实蝇 (Rhagoletis pomonella)，Sarcophaga haemorrhoidalis，麻蝇属 (Sarcophaga spp.)，Simulium vittatum，厩螯蝇 (Stomoxys calcitrans)，嗜牛虻 (Tabanus bovinus)，Tabanus atratus，Tabanus lineola，Tabanus similis，Tipula oleracea，和欧洲大蚊 (Tipula paludosa)；

[0161] 蓟马类 (缨翅目 (Thysanoptera))，例如 Dichromothrips corbetti，两色蓟马属 (Dichromothrips)ssp.，Frankliniella fusca，西花蓟马 (Frankliniella occidentalis)，东方花蓟马 (Frankliniella tritici)，Scirtothrips citri，稻蓟马 (Thrips oryzae)，棕榈蓟马 (Thrips palmi) 和烟蓟马 (Thrips tabaci)，

[0162] 白蚁类(等翅目(Isoptera)),例如Calotermes flavicollis,Leucotermes flavipes,Heterotermes aureus,欧美散白蚁(Reticulitermes flavipes),南方散白蚁(Reticulitermes virginicus),暗黑散白蚁(Reticulitermes lucifugus),桑特散白蚁(Reticulitermes santonensis),Reticulitermes grassei,Termes natalensis,和台湾乳白蚁(Coptotermes formosanus);

[0163] 蜚蠊科(蜚蠊目(Blattaria)-蜚蠊目(Blattodea)),例如德国小蠊(Blattella germanica),Blattella asahinae,美洲大蠊(Periplaneta americana),Periplaneta japan,褐斑大蠊(Periplaneta brunnea),黑胸大蠊(Periplaneta fuligginosa),澳洲大蠊(Periplaneta australasiae),和东方蜚蠊(Blatta orientalis);

[0164] 臭虫类、蚜虫类、叶蝉类、粉虱类、蚧类、蝉类(半翅目(Hemiptera)),例如拟绿蝽(Acrosternum hilare),美洲谷杆长蝽(Blissus leucopterus),黑斑烟盲蝽(Cyrtopeltis notatus),棉红蝽(Dysdercus cingulatus),Dysdercus intermedius,麦扁盾蝽(Eurygaster integriceps),褐美洲蝽(Euschistus impictivntris),棉铃喙缘蝽(Leptoglossus phyllopus),美国牧草盲蝽(Lygus lineolaris),牧草盲蝽(Lygus pratensis),稻绿蝽(Nezara viridula),方背皮蝽(Piesma quadrata),Solubea insularis,Thyanta perditor,Acyrthosiphon onobrychis,落叶松球蚜(Adelges laricis),Aphidula nasturtii,豆卫矛蚜(Aphis fabae),草莓根蚜(Aphis forbesi),苹果蚜(Aphis pomi),棉蚜(Aphis gossypii),北美茶蔗子蚜(Aphis grossulariae),希奈德蚜(Aphis schneideri),异绣线菊蚜(Aphis spiraecola),接骨木蚜(Aphis sambuci),豌豆蚜(Acyrthosiphon pisum),土豆沟无网蚜(Aulacorthum solani),银叶粉虱(Bemisia argentifolii),飞廉短尾蚜(Brachycaudus cardui),李短尾蚜(Brachycaudus helichrysi),桃短尾蚜(Brachycaudus persicae),樱桃短尾蚜(Brachycaudus prunicola),甘蓝蚜(Brevicoryne brassicae),Capitophorus horni,Cerosipha gossypii,草莓中瘤钉毛蚜(Chaetosiphon fragaefolii),茶蔗隐瘤蚜(Cryptomyzus ribis),高加索冷杉椎球蚜(Dreyfusia nordmannianae),云杉锥球蚜(Dreyfusia piceae),居根西圆尾蚜(Dysaphis radicola),Dysaulacorthum pseudosolani,车前西圆尾蚜(Dysaphis plantaginea),Dysaphis pyri,蚕虫小绿叶蝉(Empoasca fabae),梅大尾蚜(Hyalopterus pruni),茶蔗苦菜超瘤蚜(Hyperomyzus lactucae),麦长管蚜(Macrosiphum avenae),马铃薯长管蚜(Macrosiphum euphorbiae),Macrosiphon rosae,巢菜修尾蚜(Megoura viciae),Melanaphis pyrarius,麦无网蚜(metopolophium dirhodum),桃蚜(Myzus persicae),冬葱瘤蚜(Myzus ascalonicus),樱桃瘤蚜(Myzus cerasi),黄药子瘤蚜(Myzus varians),莴苣衲长管蚜(Nasonovia ribis-nigri),褐飞虱(Nilaparvata lugens),柄瘿绵蚜(Pemphigus bursarius),甘蔗扁角飞虱(Perkinsiella saccharicida),忽布疣蚜(Phorodon humuli),苹木虱(Psylla mali),Psylla piri,冬葱缢瘤蚜(Rhopalomyzus ascalonicus),玉米缢管蚜(Rhopalosiphum maidis),禾谷缢管蚜(Rhopalosiphum padi),苹果缢管蚜(Rhopalosiphum insertum),Sappaphis mala,Sappaphis mali,麦二叉蚜(Schizaphis graminum),榆梨绵蚜(Schizoneura lanuginosa),麦长管蚜(Sitobion avenae),温室粉虱(Trialeurodes vaporariorum),橘声蚜(Toxoptera aurantii)和,葡萄根瘤蚜(Viteus vitifolii),温带臭虫(Cimex

lectularius)，热带臭虫(Cimex hemipterus)，Reduvius senilis，椎猎蝽属(Triatoma spp.)，和齿背猎蝽(Arilus critatus)；

[0165] 蚂蚁、蜜蜂、胡蜂、叶蜂(膜翅目(Hymenoptera))，例如菜叶蜂(Athalia rosae)，Atta cephalotes，Atta capiguara，Atta cephalotes，Atta laevigata，Atta robusta，切叶蚁(Atta sexdens)，德州切叶蚁(Atta texana)，举腹蚊属(Crematogaster)spp.，李实叶蜂(Hoplocampa minuta)，苹实叶蜂(Hoplocampa testudinea)，黑毛蚁(Lasius niger)，小家蚁(Monomorium pharaonis)，火蚁(Solenopsis geminata)，阿根廷火蚁(Solenopsis invicta)，Solenopsis richteri，Solenopsis xyloni，Pogonomyrmex barbatus，Pogonomyrmex californicus，褐大头蚁(Pheidole megacephala)，Dasymutilla occidentalis，熊蜂属(Bombus)spp.，Vespula squamosa，Paravespula vulgaris，Paravespula pennsylvanica，Paravespula germanica，Dolichovespula maculata，Vespa crabro，Polistes rubiginosa，Camponotus floridanus，和Linepithema humile；

[0166] 蟋蟀、蚱蜢、蝗虫(直翅目(Orthoptera))，例如家蟋(Acheta domestica)，欧洲蝼蛄(Gryllotalpa gryllotalpa)，亚洲飞蝗(Locusta migratoria)，双带黑蝗(Melanoplus bivittatus)，赤胫黑蝗(Melanoplus femurrubrum)，墨西哥黑蝗(Melanoplus mexicanus)，血黑蝗(Melanoplus sanguinipes)，石枯黑蝗(Melanoplus spretus)，红蝗(Nomadacris septemfasciata)，美洲沙漠蝗(Schistocerca americana)，沙漠蝗(Schistocerca gregaria)，摩洛哥戟纹蝗(Dociostaurus maroccanus)，温室沙螽(Tachycines asynamorus)，塞纳加尔小车蝗(Oedaleus senegalensis)，Zonozerus variegatus，非洲蔗蝗(Hieroglyphus daganensis)，印度黄檀蝗(Kraussaria angulifera)，意大利蝗(Calliptamus italicus)，澳洲草栖蝗(Chortoicetes terminifera)，和褐飞拟飞蝗(Locustana pardalina)；

[0167] 蛛形纲，如蛛形类(蜱螨目(Acarina))，例如软蜱科(Argasidae)，硬蜱科(Ixodidae)和疥螨科(Sarcoptidae)，如美洲花蜱(Amblyomma americanum)，彩饰花蜱(Amblyomma variegatum)，有斑花蜱(Ambryomma maculatum)，波斯锐缘蜱(Argas persicus)，具环牛蜱(Boophilus annulatus)，消色牛蜱(Boophilus decoloratus)，微小牛蜱(Boophilus microplus)，森林革蜱(Dermacentor silvarum)，安氏革蜱(Dermacentor andersoni)，变异革蜱(Dermacentor variabilis)，Hyalomma truncatum，蓖子硬蜱(Ixodes ricinus)，Ixodes rubicundus，Ixodes scapularis，全环硬蜱(Ixodes holocyclus)，Ixodes pacificus，非洲钝缘蜱属(Ornithodorus moubata)，Ornithodorus hermsi，Ornithodorus turicata，柏氏禽刺螨(Ornithonyssus bacoti)，Otobius megnini，鸡皮刺螨(Dermanyssus gallinae)，绵羊瘙螨(Psoroptes ovis)，血红扇头蜱(Rhipicephalus sanguineus)，非洲扇头蜱(Rhipicephalus appendiculatus)，Rhipicephalus evertsi，人疥螨(Sarcoptes scabiei)，和瘿螨科(Eriophyidae spp.)如斯氏针刺瘿螨(Aculus schlechtendali)，柑橘皱叶刺瘿螨(Phyllocoptrata oleivora)和Eriophyes sheldoni；跗线螨科(Tarsonemidae spp.)如樱草植食螨(Phytonemus pallidus)和侧多食跗线螨(Polyphagotarsonemus latus)；细须螨科(Tenuipalpidae spp.)如紫红短须螨(Brevipalpus phoenicis)；叶螨科(Tetranychidae spp.)如朱砂叶螨(Tetranychus cinnabarinus)，神泽氏叶螨(Tetranychus kanzawai)，太平

洋叶螨(Tetranychus pacificus),榆两点叶螨(Tetranychus telarius)和二斑叶螨(Tetranychus urticae),苹果全爪螨(Panonychus ulmi),柑橘全爪螨(Panonychus citri),和草地小爪螨(Oligonychus pratensis);蛛形目(Araneida),例如红斑蛛(Latrodectus mactans),和褐平甲蛛(Loxosceles reclusa);

[0168] 蚤类(蚤目(Siphonaptera)),例如猫栉首蚤(Ctenocephalides felis),犬栉首蚤(Ctenocephalides canis),印鼠客蚤(Xenopsylla cheopis),人蚤(Pulex irritans),穿皮潜蚤(Tunga penetrans),和具带病蚤(Nosopsyllus fasciatus),

[0169] 衣鱼、家衣鱼(缨尾目(Thysanura)),例如台湾衣鱼(Lepisma saccharina)和家衣鱼(Thermobia domestica),

[0170] 蜈蚣(唇足纲(Chilopoda)),Scutigera coleoptrata,

[0171] 千足虫(倍足纲(Diplopoda)),例如Narceus spp.,

[0172] 蠼螋(革翅目(Dermaptera)),例如Forficula auricularia,

[0173] 虱类(虱目(Phthiraptera)),例如头虱(Pediculus humanus capitis),人虱属(Pediculus humanus corporis,Pthirus pubis,牛血虱(Haematopinus eurysternus),猪血虱(Haematopinus suis),牛颚虱(Linognathus vituli),Bovicola bovis,Menopon gallinae,雏鸡羽虱(Menacanthus stramineus)和牛管虱(Solenopotes capillatus)。

[0174] 弹尾目(Collembola)(跳虫),例如Onychiurus ssp.。

[0175] 它们也适于防除线虫类:植物寄生线虫类如根结线虫,北方根结线虫(Meloidogyne hapla),南方根结线虫(Meloidogyne incognita),爪哇根结线虫(Meloidogyne javanica),和其它根结线虫属(Meloidogyne);孢囊-形成线虫类,马铃薯金线虫(Globodera rostochiensis)和其它球异皮线虫属(Globodera),Heterodera avenae,大豆异皮线虫(Heterodera glycines),甜菜异皮线虫(Heterodera schachtii),三叶草异皮线虫(Heterodera trifolii),和其它异皮线虫属(Heterodera);种瘿线虫类,瘿线虫属(Anguina);茎干和叶面线虫类,滑刃线虫属(Aphelenchoides);刺线虫类,长尾刺线虫(Belonolaimus longicaudatus)和其它刺线虫属(Belonolaimus);松线虫类,松材线虫(Bursaphelenchus xylophilus)和其它伞滑刃线虫属(Bursaphelenchus);环线虫类,Criconema,Criconemella,Criconemoides,间环线虫属(Mesocriconema);茎干和鳞茎线虫类,马铃薯茎线虫(Ditylenchus destructor),起绒草茎线虫(Ditylenchus dipsaci)和其它茎线虫属(Ditylenchus);锥线虫类,锥线虫属(Dolichodorus);螺旋线虫类,Heliocotylenchus multicinctus和其它螺旋线虫属(Helicotylenchus);鞘和拟鞘线虫类,鞘线虫属(Hemicycliophora)和半轮线虫属(Hemicriconemoides);Hirshmanniella;纽带线虫类,纽带线虫属(Hoploaimus);伪根结线虫类,真珠线虫属(Nacobbus);长针线虫类,逸去长针线虫(Longidorus elongatus)和其它长针线虫属(Longidorus);根斑线虫,落选短体线虫(Pratylenchus neglectus),穿刺短体线虫(Pratylenchus penetrans),Pratylenchus curvitatus,古氏短体线虫(Pratylenchus goodeyi)和其它短体线虫属(Pratylenchus);潜伏线虫类,相似穿孔线虫(Radopholus similis)和其它穿孔线虫属(Radopholus);肾形线虫类,强壮盘旋线虫(Rotylenchus robustus)和其它盘旋线虫属(Rotylenchus);盾状线虫属(Scutellonema);粗短根线虫类,原始毛刺线虫(Trichodorus primitivus)和其它毛刺线虫属(Trichodorus),类毛刺线虫属

(Paratrichodorus)；矮化线虫类，克莱顿矮化线虫(Tylenchorhynchus claytoni)，不定矮化线虫(Tylenchorhynchus dubius)和其它矮化线虫属(Tylenchorhynchus)；柑橘属线虫类，小垫刃线虫属(Tylenchulus)；剑线虫类，剑线虫属(Xiphinema)；和其它植物寄生性线虫种类。

[0176] 式I化合物及其盐也用于防除蛛形类(Arachnoidea)，如蜱螨类(蜱螨目(Acarina))，例如软蜱科(Argasidae)，硬蜱科(Ixodidae)和疥螨科(Sarcoptidae)，美洲花蜱(Amblyomma americanum)，彩饰花蜱(Amblyomma variegatum)，波斯锐缘蜱(Argas persicus)，具环牛蜱(Boophilus annulatus)，消色牛蜱(Boophilus decoloratus)，微小牛蜱(Boophilus microplus)，森林革蜱(Dermacentor silvarum)，Hyalomma truncatum，蓖子硬蜱(Ixodes ricinus)，Ixodes rubicundus，非洲钝缘蜱属(Ornithodorus moubata)，Otobius megnini，鸡皮刺螨(Dermanyssus gallinae)，绵羊瘙螨(Psoroptes ovis)，非洲扇头蜱(Rhipicephalus appendiculatus)，Rhipicephalus evertsi，人疥螨(Sarcoptes scabiei)，和瘿螨科(Eriophyidae spp.)如斯氏针刺瘿螨(Aculus schlechtendali)，柑橘皱叶刺瘿螨(Phyllocoptrata oleivora)和Eriophyes sheldoni；跗线螨科(Tarsonemidae spp.)如樱草植食螨(Phytonemus pallidus)和侧多食跗线螨(Polyphagotarsonemus latus)；细须螨科(Tenuipalpidae spp.)如紫红短须螨(Brevipalpus phoenicis)；叶螨科(Tetranychidae spp.)如朱砂叶螨(Tetranychus cinnabarinus)，神泽氏叶螨(Tetranychus kanzawai)，太平洋叶螨(Tetranychus pacificus)，极两点叶螨(Tetranychus telarius)和二斑叶螨(Tetranychus urticae)，苹果全爪螨(Panonychus ulmi)，柑橘全爪螨(Panonychus citri)，和草地小爪螨(Oligonychus pratensis)。

[0177] 式I化合物特别有用地防除昆虫，优选地吮汁或钻孔昆虫类如下述昆虫类：缨翅目(Thysanoptera)，双翅目(Diptera)和半翅目(Hemiptera)；特别是以下种类：

[0178] 缨翅目(Thysanoptera)：Frankliniella fusca，西花蓟马(Frankliniella occidentalis)，东方花蓟马(Frankliniella tritici)，Scirtothrips citri，稻蓟马(Thrips oryzae)，棕榈蓟马(Thrips palmi)和烟蓟马(Thrips tabaci)；

[0179] 双翅目，例如埃及伊蚊，白条伊蚊，刺扰伊蚊，墨西哥按实蝇，五斑按蚊，Anopheles crucians，Anopheles albimanus，冈比亚按蚊，Anopheles freeborni，Anopheles leucosphyrus，微小按蚊，四斑按蚊，红头丽蝇，地中海实蝇，蛆症金蝇，Chrysomya hominivorax，Chrysomya macellaria，Chrysops discalis，Chrysops silacea，Chrysops atlanticus，嗜人锥蝇，高粱康瘿蚊，噬人瘤蝇，Culicoides furens，尖音库蚊，Culex nigripalpus，致倦库蚊，Culex tarsalis，Culiseta inornata，Culiseta melanura，瓜寡鬃实蝇，油橄榄果实蝇，油菜叶瘿蚊，葱地种蝇，麦地种蝇，灰地种蝇，甘蓝地种蝇，人肤蝇，夏厕蝇，三点尺禾蝇，肠胃蝇，刺舌蝇，须舌蝇，棕足舌蝇，拟寄舌蝇，西方角蝇，鞍瘿蚊，Hippelates spp.，灰地种蝇，Hypoderma lineata，Leptoconops torrens，蔬菜斑潜蝇，三叶草斑潜蝇，Lucilia caprina，铜绿蝇，丝光绿蝇，Lycoria pectoralis，Mansonia titillanus，小麦瘿蚊，秋家蝇，家蝇，厩腐蝇，羊狂蝇，禾蝇，瑞典麦秆蝇，波菜泉蝇，Phorbia antiqua，萝卜地种蝇，Phorbia coarctata，Phlebotomus argentipes，Psorophora columbiae，胡萝卜茎蝇，Psorophora discolor，Prosimulium mixtum，樱桃绕实蝇，苹绕实

蝇，Sarcophaga haemorrhoidalis，麻蝇属，Simulium vittatum，厩螯蝇，嗜牛虻，Tabanus atratus，Tabanus lineola，Tabanus similis，Tipula oleracea，和欧洲大蚊；

[0180] 半翅目(Hemiptera)，Acyrthosiphon onobrychis，落叶松球蚜，Aphidula nasturtii，豆卫矛蚜，草莓根蚜，苹果蚜，棉蚜，北美茶蔗子蚜，希奈德蚜，异绣线菊蚜，接骨木蚜，豌豆蚜，土豆沟无网蚜，飞廉短尾蚜，李短尾蚜，桃短尾蚜，樱桃短尾蚜，甘蓝蚜，Capitophorus horni，Cerosipha gossypii，草莓中瘤钉毛蚜，茶蔗隐瘤蚜，高加索冷杉椎球蚜，云杉锥球蚜，居根西圆尾蚜，Dysaulacorthum pseudosolani，车前西圆尾蚜，Dysaphis pyri，蚕虫小绿叶蝉，梅大尾蚜，茶蔗苦菜超瘤蚜，麦长管蚜，马铃薯长管蚜，Macrosiphon rosae，巢菜修尾蚜，Melanaphis pyrarius，麦无网蚜，Myzodes persicae，冬葱瘤蚜，樱桃瘤蚜，黄药子瘤蚜，莴苣衲长管蚜，褐飞虱，柄瘿绵蚜，甘蔗扁角飞虱，忽布疣蚜，苹木虱，Psylla piri，冬葱缢瘤蚜，玉米缢管蚜，禾谷缢管蚜，苹果缢管蚜，Sappaphis mala，Sappaphis mali，麦二叉蚜，榆梨绵蚜，麦长管蚜，温室粉虱，橘声蚜，和葡萄根瘤蚜；

[0181] 式Ⅰ化合物特别有用地防除半翅目(Hemiptera)和缨翅目(Thysanoptera)的昆虫类。

[0182] 配制剂

[0183] 为了用于根据本发明的方法，可以将式Ⅰ化合物转化为常规配制剂，例如溶液，乳液，悬浮液，尘剂，粉剂，糊剂，颗粒剂和直接可喷洒的溶液。使用形式取决于具体目的和施用方法。选择配制剂和施用方法以确保在各情况下根据本发明的式Ⅰ化合物的精细且均匀的分布。

[0184] 配制剂以已知方式制备(参见例如综述US 3,060,084，EP-A 707 445(液体浓缩物)，Browning，"Agglomeration"，Chemical Engineering，Dec.4,1967,147-48，Perry′s Chemical Engineer′s Handbook,4th Ed.，McGraw-Hill，New York,1963，第8-57页和以及下述WO 91/13546，US 4,172,714，US 4,144,050，US 3,920,442，US 5,180,587，US 5,232,701，US 5,208,030，GB 2,095,558，US 3,299,566，Klingman，Weed Control as a Science，John Wiley and Sons，Inc.，New York,1961，Hance等人，Weed Control Handbook,8th Ed.，Blackwell Scientific Publications，Oxford，1989和Mollet，H.，Grubemann，A.，Formulation technology，Wiley VCH Verlag GmbH，Weinheim(Germany)，2001,2.D.A.Knowles，Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations，Kluwer Academic Publishers，Dordrecht,1998(ISBN 0-7514-0443-8)，例如通过用适于配制农业化学品的助剂来拓展活性化合物，所述助剂是如溶剂和/或载体，如果希望的乳化剂，表面活性剂和分散剂，保藏剂，消泡剂，抗冻剂，对于种子处理剂配制剂还任选是着色剂和/或粘合剂和/或成胶剂。

[0185] 适宜的溶剂/载体是例如：

[0186] -溶剂，如水，芳族溶剂(例如Solvesso产品，二甲苯等)，烷烃(例如矿物级分)，醇类(例如甲醇，丁醇，戊醇，苯甲醇)，酮类(例如环己酮、γ-丁内酯)，吡咯烷酮(N-甲基-吡咯烷酮(NMP)、N-辛基吡咯烷酮NOP)，乙酸酯(二乙酸二醇酯)，烷基乳酸酯，内酯类如g-丁内酯，二醇类，脂肪酸二甲酰胺，脂肪酸和脂肪酸酯类，甘油三酯，植物或动物来源的油和经修饰的油如烷化植物油。原则上还可使用溶剂混合物。

[0187] -载体，如磨碎的天然矿物和磨碎的合成矿物，如硅胶，细分散的硅酸，硅酸盐类，

滑石粉，高岭土，Attaclay，石灰石，石灰，白垩，红玄武土，黄土，粘土，白云石，硅藻土，硫酸钙和硫酸镁，氧化镁，磨碎的合成材料，肥料，例如硫酸铵，磷酸铵，硝酸铵，脲类和植物来源的产品如谷粉、树皮粉、木粉和坚果壳粉、纤维素粉末和其它固体载体。

[0188] 适宜的乳化剂是非离子型和阴离子型乳化剂（例如聚氧基乙烯脂肪醇醚类，烷基磺酸盐和芳基磺酸盐）。

[0189] 分散剂的实例是木质素 - 亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

[0190] 适宜的表面活性剂包括下述的碱金属，碱土金属和铵盐：木质磺酸、萘磺酸、苯酚磺酸、二丁基萘磺酸的、烷基芳基磺酸酯，烷基硫酸酯，烷基磺酸酯，脂肪醇硫酸酯，脂肪酸和硫酸化的脂肪醇二醇醚类；进一步包括磺化萘和萘衍生物与甲醛的缩合物，萘或萘磺酸与苯酚和甲醛的缩合物，聚氧基乙烯辛基苯基醚，乙氧基化异辛基苯酚，辛基苯酚，壬基苯酚，烷基苯基聚乙二醇醚，三丁基苯基聚乙二醇醚，三硬脂基苯基聚乙二醇醚，烷基芳基聚醚醇类，醇和脂肪醇 / 环氧乙烷缩合物，乙氧基化蓖麻油，聚氧乙烯烷基醚，乙氧基化聚氧基丙烯，月桂醇聚乙二醇醚缩醛，和山梨醇酯类。

[0191] 还可以将抗凝剂如甘油，1,2- 乙二醇，丙二醇和杀菌剂加入配制剂。

[0192] 适宜的消泡剂是例如消泡剂基于硅或硬脂酸镁。

[0193] 适宜的保藏剂包括例如，双氯酚 (dichlorophen) 和苯甲醇半缩甲醛。

[0194] 适宜的增稠剂包括化合物，其可以将假塑性流动行为赋予配制剂，即静止时高粘度和搅动阶段低粘度。在该上下文中可以提及例如基于多糖类的商业增稠剂，如黄原胶®(Kelzan®，来自 Kelco)，Rhodopol®23(Rhone Poulenc) 或 Veegum®（来自 R.T.Vanderbilt)，或者有机页硅酸盐，如 Attaclay®（来自 Engelhardt)。适于根据本发明的分散液的消泡剂是，例如，硅酮乳液（例如 Silikon®SRE，Wacker 或 Rhodorsil®，来自 Rhodia)，长链醇类，脂肪酸，有机氟化合物及其混合物。可以加入杀生物剂来稳定化根据本发明的所述组合物以对抗微生物攻击。适宜的杀生物剂例如基于异噻唑酮类比如以商标 Avecia 的 Proxel®（或 Arch) 或 Thor Chemie 的 Acticide®RS 和 Rohm & Haas 的 Kathon® MK 销售的化合物。适宜的防冻剂是有机多元醇，例如 1,2- 乙二醇，丙二醇或甘油。这些通常以不超过 10 重量％的量采用，基于活性化合物组合物总重量。如果适当的，根据本发明的活性化合物组合物可包含按所制备的配制剂的总量计 1 至 5 重量％的缓冲剂用来调节 pH，所用缓冲剂的量和类型取决于活性化合物或多种活性化合物的化学性质。缓冲剂的实例是弱无机或有机酸例如磷酸、烃基代硼酸、乙酸、丙酸、柠檬酸、富马酸、酒石酸、草酸和琥珀酸的碱金属盐。

[0195] 适于制备直接可喷洒的溶液、乳液、糊剂或油分散液的物质包括中至高沸点的矿物油级分，如煤油或柴油，进一步包括煤焦油和植物或动物来源的油，脂族、环状和芳族烃例如甲苯、二甲苯、石蜡、萘满、烷化的萘或它们的衍生物，甲醇，乙醇，丙醇，丁醇，环己醇，环己酮，异佛尔酮，强极性溶剂例如二甲亚砜、N- 甲基吡咯烷酮和水。

[0196] 粉剂、扩散材料和尘剂能够通过将活性物质与固体载体一起混合或研磨来制备。

[0197] 颗粒剂例如包衣颗粒剂、浸渍颗粒剂和均质颗粒剂能够通过将活性成分结合至固体载体来制备。固体载体的实例是矿物土如硅胶，硅酸盐类，滑石粉，高岭土，Attaclay，石灰石，石灰，白垩，红玄武土，黄土，粘土，白云石，硅藻土，硫酸钙，硫酸镁，氧化镁，磨碎的合成材料，肥料例如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、脲类，和植物来源的产品如谷粉、树皮粉、木粉和

坚果壳粉、纤维素粉末和其它固体载体。

[0198] 一般而言，配制剂包含 0.01 至 95 重量%，优选 0.1 至 90 重量%的活性成分。活性成分以 90%至 100%，优选 95%至 100%（根据 NMR 谱）纯度采用。

[0199] 为了种子处理目的，能够将各配制剂稀释 2-10 倍，得到的即用制剂的浓度按活性化合物重量计为 0.01 至 60 重量%，优选 0.1 至 40 重量%。

[0200] 式 I 化合物可以原样、以它们的配制剂形式或自其制备的使用形式，例如以直接可喷洒的溶液、粉末、悬浮液或分散液、乳液、油分散液、糊剂、可喷粉产品、播散材料或颗粒剂形式，通过喷洒、喷雾、喷粉、铺展或浇灌来使用。使用形式完全取决于期望的意图；它们意图在各情况下确保根据本发明的活性化合物的尽可能的精细分布。

[0201] 以下是非限制性的实例配制剂：

[0202] 1. 用水稀释的产品。出于种子处理剂意图，此种产品可以经稀释

[0203] 或未经稀释地施用至种子。

[0204] A) 水可溶性浓缩物 (SL, LS)

[0205] 将 10 重量份的活性化合物溶于 90 重量份的水或水溶性溶剂。作为备选，加入湿润剂或其它助剂。活性化合物在用水稀释时溶解，此时获得 10% (w/w) 活性化合物的配制剂。

[0206] B) 可分散液剂 (DC)

[0207] 将 20 重量份的活性化合物溶于 70 重量份的环己酮，加入 10 重量份的分散剂例如聚乙烯吡咯烷酮。用水稀释提供分散液，此时获得 20% (w/w) 活性化合物的配制剂。

[0208] C) 乳油 (EC)

[0209] 将 15 重量份的活性化合物溶于 7 重量份的二甲苯，加入十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物（在各情况下 5 重量份）。用水稀释提供乳液，此时获得 15% (w/w) 活性化合物的配制剂。

[0210] D) 乳液 (EW, EO, ES)

[0211] 将 25 重量份的活性化合物溶于 35 重量份的二甲苯，加入十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物（在各情况下 5 重量份）。通过乳化机械（例如 Ultraturrax）将该混合物引入 30 重量份的水，并制成均质乳液。用水稀释提供乳液，此时获得 25% (w/w) 活性化合物的配制剂。

[0212] E) 悬浮液 (SC, OD, FS)

[0213] 在搅动的球磨机中，粉碎 20 重量份的活性化合物，加入 10 重量份的分散剂、湿润剂和 70 重量份的水或有机溶剂以获得精细的活性化合物悬浮液。用水稀释提供活性化合物的稳定的悬浮液，此时获得 20% (w/w) 活性化合物的配制剂。

[0214] F) 水 - 可分散性粒剂和水溶性颗粒剂 (WG, SG)

[0215] 通过技术设备（例如挤出、喷雾塔、流化床）细磨 50 重量份的活性化合物，加入 50 重量份的分散剂和湿润剂，并制成水 - 可分散的或水溶性颗粒剂。用水稀释提供活性化合物的稳定的分散液或溶液，此时获得 50% (w/w) 活性化合物的配制剂。

[0216] G) 水 - 可分散的粉末和水 - 可溶性粉剂 (WP, SP, SS, WS)

[0217] 在转子 - 定子研磨机磨碎 75 重量份的活性化合物，加入 25 重量份的分散剂、湿润剂和硅胶。用水稀释提供活性化合物的稳定的分散液或溶液，此时获得 75% (w/w) 活性化

合物的配制剂。

[0218] H) 凝胶 - 配制剂 (GF)

[0219] 在搅动的球磨机，粉碎 20 重量份的活性化合物，加入 10 重量份的分散剂，1 重量份的成胶剂湿润剂和 70 重量份的水或有机溶剂以获得精细的活性化合物悬浮液。用水稀释提供活性化合物的稳定的悬浮液，此时获得 20％ (w/w) 活性化合物的配制剂。

[0220] 2. 用于叶面施用的未经稀释地施用的产品。为了种子处理意图，此种产品可以经稀释或未经稀释地施用至种子。

[0221] I) 粉剂 (DP，DS)

[0222] 细磨 5 重量份的活性化合物，与 95 重量份的细分散的高岭土密切地混合。这提供具有 5％ (w/w) 活性化合物的可喷粉产品。

[0223] J) 颗粒剂 (GR，FG，GG，MG)

[0224] 细磨 0.5 重量份的活性化合物并与 95.5 重量份的载体合并，此时获得具有 0.5％ (w/w) 活性化合物的配制剂。目前的方法是挤出、喷雾干燥或流化床。这提供用于叶面用途的未经稀释地施用的颗粒剂。

[0225] K)ULV 溶液 (UL)

[0226] 将 10 重量份的活性化合物溶于 90 重量份的有机溶剂例如二甲苯。这提供具有 10％ (w/w) 活性化合物的产品，将其未经稀释地施用用于叶面用途。

[0227] 通过加水，含水使用形式能够制备自乳液浓缩物、糊剂或可湿性粉剂（可喷洒性粉末，油分散液）。为了制备乳液、糊剂或油分散液，可将原样或溶于油或溶剂的物质通过湿润剂、增粘剂、分散剂或乳化剂在水中匀化。备选地，能够制备浓缩物，其包括活性物质、湿润剂、增粘剂、分散剂或乳化剂和，如果适当的，溶剂或油；并且此种浓缩物适于用水稀释。

[0228] 即用产品中的活性成分浓度能够在相对宽范围内变化。一般而言，范围是 0.0001 至 10％，优选 0.01 至 1％。

[0229] 活性成分还可成功地以超低 - 体积过程 (ULV) 使用，可能施用包含超过 95 重量％的活性成分的配制剂，甚或无需添加剂地施用活性成分。

[0230] 混合物

[0231] 在本发明的方法中，式 I 化合物可以与其它活性成分，例如与其它杀虫剂，杀昆虫剂，除草剂，肥料如硝酸铵、尿素、草碱和超级磷酸盐 (superphosphate)，植物毒素和植物生长调节剂，安全剂和杀线虫剂一起施用。这些另外的成分可以按顺序使用或与上述组合物组合使用，如果适当的也仅在使用之前立即加入（桶混）。例如，植物可以在用其它活性成分处理之前或之后用本发明组合物喷雾。

[0232] 可以将以下列表 M 的杀虫剂与根据本发明的化合物一起使用，其可能产生潜在增效效果。其仅意图阐明可能的组合，但不是对其施加任意限制：

[0233] M.1. 有机（硫代）磷酸盐化合物：乙酰甲胺磷 (acephate)，甲基吡噁磷 (azamethiphos)，益棉磷 (azinphos-ethyl)，保棉磷 (az inphos-methyl)，氯氧磷 (chlorethoxyfos)，氯芬磷 (chlorfenvinphos)，氯甲硫磷 (chlormephos)，毒死蜱 (chlorpyrifos)，甲基毒死蜱 (chlorpyrifos-methyl)，蝇毒磷 (coumaphos)，杀螟腈 (cyanophos)，甲基内吸磷 (demeton-S-methyl)，二嗪磷 (diazinon)，敌敌畏 (dichlorvos/DDVP)，百治磷 (dicrotophos)，乐果 (dimethoate)，甲基毒虫畏

(dimethylvinphos)，乙拌磷 (disulfoton)，苯硫膦 (EPN)，乙硫磷 (ethion)，灭线磷 (ethoprophos)，伐灭磷 (famphur)，苯线磷 (fenamiphos)，杀螟硫磷 (fenitrothion)，倍硫磷 (fenthion)，flupyrazophos，噻唑磷 (fosthiazate)，庚烯磷 (heptenophos)，噁唑磷 (isoxathion)，马拉硫磷 (malathion)，灭蚜磷 (mecarbam)，甲胺磷 (methamidophos)，杀扑磷 (methidathion)，速灭磷 (mevinphos)，久效磷 (monocrotophos)，二溴磷 (naled)，氧乐果 (omethoate)，亚砜磷 (oxydemeton-methyl)，对硫磷 (parathion)，甲基对硫磷 (parathion-methyl)，稻丰散 (phenthoate)，甲拌磷 (phorate)，伏杀硫磷 (phosalone)，亚胺硫磷 (phosmet)，磷胺 (phosphamidon)，肟硫磷 (phoxim)，甲基嘧啶磷 (pirimiphos-methyl)，丙溴磷 (profenofos)，胺丙畏 (propetamphos)，丙硫磷 (prothiofos)，吡唑硫磷 (pyraclofos)，哒嗪硫磷 (pyridaphenthion)，喹硫磷 (quinalphos)，治螟磷 (sulfotep)，丁基嘧啶磷 (tebupirimfos)，替美磷 (temephos)，特丁磷 (terbufos)，司替罗磷 (tetrachlorvinphos)，甲基乙拌磷 (thiometon)，三唑磷 (triazophos)，敌百虫 (trichlorfon)，蚜灭磷 (vamidothion)；

[0234] M.2. 氨基甲酸酯化合物：涕灭威 (aldicarb)，棉铃威 (alanycarb)，噁虫威 (bendiocarb)，丙硫克百威 (benfuracarb)，丁酮威 (butocarboxim)，丁酮砜威 (butoxycarboxim)，甲萘威 (carbaryl)，克百威 (carbofuran)，丁硫克百威 (carbosulfan)，乙硫苯威 (ethiofencarb)，仲丁威 (fenobucarb)，伐虫脒 (formetanate)，呋线威 (furathiocarb)，异丙威 (isoprocarb)，甲硫威 (methiocarb)，灭多威 (methomyl)，速灭威 (metolcarb)，杀线威 (oxamyl)，抗蚜威 (pirimicarb)，残杀威 (propoxur)，硫双威 (thiodicarb)，久效威 (thiofanox)，混杀威 (trimethacarb)，灭除威 (XMC)，灭杀威 (xylylcarb)，唑蚜威 (triazamate)；

[0235] M.3. 拟除虫菊酯 (pyrethroid) 化合物：氟丙菊酯 (acrinathrin)，烯丙菊酯 (allethrin)，d-顺式-反式烯丙菊酯 (allethrin)，d-反式烯丙菊酯 (allethrin)，联苯菊酯 (bifenthrin)，生物烯丙菊酯 (bioallethrin)，S-生物烯丙菊酯 (bioallethrin S-cylclopentenyl)，生物苄呋菊酯 (bioresmethrin)，乙氰菊酯 (cycloprothrin)，氟氯氰菊酯 (cyfluthrin)，b-氟氯氰菊酯 (beta-cyfluthrin)，氯氟氰菊酯 (cyhalothrin)，高效氯氟氰菊酯 (lambda-cyhalothrin)，γ-氯氟氰菊酯 (cyhalothrin)，氯氰菊酯 (cypermethrin)，a-氯氰菊酯 (alpha-cypermethrin)，b-氯氰菊酯 (beta-cypermethrin)，θ-氯氰菊酯 (theta-cypermethrin)，ξ-氯氰菊酯 (zeta-cypermethrin)，苯醚氰菊酯 (cyphenothrin)，溴氰菊酯 (deltamethrin)，右旋烯炔菊酯 (empenthrin)，S-氰戊菊酯 (esfenvalerate)，醚菊酯 (etofenprox)，甲氰菊酯 (fenpropathrin)，氰戊菊酯 (fenvalerate)，氟氰戊菊酯 (flucythrinate)，氟氯苯菊酯 (flumethrin)，氟胺氰菊酯 (tau-fluvalinate)，苄螨醚 (halfenprox)，炔咪菊酯 (imiprothrin)，甲氧苄氟菊酯 (metofluthrin)，扑灭司林 (permethrin)，苯氧司林 (phenothrin)，右旋炔丙菊酯 (prallethrin)，profluthrin，除虫菊素 (pyrethrin)(除虫菊素 (pyrethrum))，苄呋菊酯 (resmethrin)，氟硅菊酯 (silafluofen)，七氟菊酯 (tefluthrin)，四甲司林 (tetramethrin)，四溴菊酯 (tralomethrin)，四氟苯菊酯 (transfluthrin)；

[0236] M.4. 保幼激素模拟物：烯虫乙酯 (hydroprene)，烯虫炔酯 (kinoprene)，烯虫酯 (methoprene)，苯氧威 (fenoxycarb)，吡丙醚 (pyriproxyfen)；

[0237] M.5. 烟酸受体激动剂 / 拮抗剂化合物：啶虫脒 (acetamiprid)，杀虫磺 (bensultap)，杀螟丹 (cartap) 盐酸化物，噻虫胺 (clothianidin)，呋虫胺 (dinotefuran)，吡虫啉 (imidacloprid)，噻虫嗪 (thiamethoxam)，尼藤吡蓝 (nitenpyram)，烟碱，多杀霉素 (spinosad)(变构激动剂)，乙基多杀菌素 (spinetoram)(变构激动剂)，噻虫啉 (thiacloprid)，杀虫环 (thiocyclam)，杀虫酸 - 钠盐 (thiosultap-sodium) 和 AKD1022。

[0238] M.6.GABA 门控氯化物通道拮抗剂化合物：氯丹 (chlordane)，硫丹 (endosulfan)，gamma-hch(林丹 (lindane))；乙虫腈 (ethiprole)，氟虫腈 (fipronil)，pyrafluprole，pyriprole

[0239] M.7. 氯化物通道活化剂：阿维菌素 (abamectin)，甲氨基阿维菌素苯甲酸盐 (emamectin benzoate)，弥拜菌素 (milbemectin)，lepimectin；

[0240] M.8.METI I 化合物：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)，flufenerim，鱼藤酮 (rotenone)；

[0241] M.9.METI II 和 III 化合物：灭螨醌 (acequinocyl)，fluacyprim，氟蚁腙 (hydramethylnon)；

[0242] M.10. 氧化磷酰化的解偶联剂：溴虫腈 (chlorfenapyr)，二硝酚 (DNOC)；

[0243] M.11. 氧化磷酰化的抑制剂：三唑锡 (azocyclotin)，三环锡 (cyhexatin)，丁醚脲 (diafenthiuron)，苯丁锡 (fenbutatin oxide)，炔螨特 (propargite)，三氯杀螨砜 (tetradifon)；

[0244] M.12. 蜕皮破坏剂：环丙马秦 (cyromazine)，环虫酰肼 (chromafenozide)，氯虫酰肼 (halofenozide)，甲氧虫酰肼 (methoxyfenozide)，虫酰肼 (tebufenozide)；

[0245] M.13. 增效剂：增效醚 (piperonyl butoxide)，脱叶磷 (tribufos)；

[0246] M.14. 钠通道封闭化合物：茚虫威 (indoxacarb)，氰氟虫腙 (metaflumizone)；

[0247] M.15. 烟熏剂：溴甲烷 (methyl bromide)，氯化苦 (chloropicrin) 硫酰氟 (sulfuryl fluoride)；

[0248] M.16. 选择性摄食阻断剂：crylotie，吡蚜酮 (pymetrozine)，氟啶虫酰胺 (flonicamid)；

[0249] M.17. 螨类生长抑制剂 (growth inhibitors)：四螨嗪 (clofentezine)，噻螨酮 (hexythiazox)，乙螨唑 (etoxazole)；

[0250] M.18. 壳多糖合成抑制剂：噻嗪酮 (buprofezin)，双三氟虫脲 (bistrifluron)，氟啶脲 (chlorfluazuron)，除虫脲 (diflubenzuron)，氟环脲 (flucycloxuron)，氟虫脲 (flufenoxuron)，氟铃脲 (hexaflumuron)，氯芬奴隆 (lufenuron)，氟酰脲 (novaluron)，多氟脲 (noviflumuron)，氟苯脲 (teflubenzuron)，杀铃脲 (triflumuron)；

[0251] M.19. 脂质生物合成抑制剂：螺螨酯 (spirodiclofen)，螺甲螨酯 (spiromesifen)，螺虫乙酯 (spirotetramat)；

[0252] M.20.Octapaminergic 激动剂：阿米曲士 (amitraz)；

[0253] M.21. 雷诺定 (ryanodine) 受体调节剂：氟虫酰胺 (flubendiamide) 和邻苯二酰胺化合物 (R)-，(S)-3- 氯 -N1-{2- 甲基 -4-[1,2,2,2- 四氟 -1-(三氟甲基) 乙基] 苯基 }-N2-(1- 甲基 -2- 甲磺酰基乙基) 邻苯二酰胺 (M21.1)，

[0254] M.22. 异噁唑啉化合物 :4-[5-(3,5- 二氯 - 苯基)-5- 三氟甲基 -4,5- 二氢 - 异噁唑 -3- 基]-2- 甲基 -N- 吡啶 -2- 基甲基 - 苯甲酰胺 (M22.1),

[0255] 4-[5-(3,5- 二氯 - 苯基)-5- 三氟甲基 -4,5- 二氢 - 异噁唑 -3- 基]-2- 甲基 -N-(2,2,2- 三氟 - 乙基)- 苯甲酰胺 (M22.2),

[0256] 4-[5-(3,5- 二氯 - 苯基)-5- 三氟甲基 -4,5- 二氢 - 异噁唑 -3- 基]-2- 甲基 -N-[(2,2,2- 三氟 - 乙基氨基甲酰基)- 甲基]- 苯甲酰胺 (M22.3),

[0257] 4-[5-(3,5- 二氯 - 苯基)-5- 三氟甲基 -4,5- 二氢 - 异噁唑 -3- 基]- 萘 -1- 羧酸 [(2,2,2- 三氟 - 乙基氨基甲酰基)- 甲基]- 酰胺 (M22.4) 和

[0258] 4-[5-(3,5- 二氯苯基)-5- 三氟甲基 -4,5- 二氢 - 异噁唑 -3- 基]-N-[(甲氧基亚氨基) 甲基]-2- 甲基苯甲酰胺 (M22.5) ;

[0259] M.23. 邻氨基苯甲酸内酰胺化合物 :氯虫苯甲酰胺 (chloranthraniliprole), 氰虫苯甲酰胺 (cyantraniliprole),

[0260] 5- 溴 -2-(3- 氯 - 吡啶 -2- 基)-2H- 吡唑 -3- 羧酸 [4- 氰基 -2-(1- 环丙基 - 乙基氨基甲酰基)-6- 甲基 - 苯基]- 酰胺 (M23.1),

[0261] 5- 溴 -2-(3- 氯 - 吡啶 -2- 基)-2H- 吡唑 -3- 羧酸 [2- 氯 -4- 氰基 -6-(1- 环丙基 - 乙基氨基甲酰基)- 苯基]- 酰胺 (M23.2),

[0262] 5- 溴 -2-(3- 氯 - 吡啶 -2- 基)-2H- 吡唑 -3- 羧酸 [2- 溴 -4- 氰基 -6-(1- 环丙基 - 乙基氨基甲酰基)- 苯基]- 酰胺 (M23.3),

[0263] 5- 溴 -2-(3- 氯 - 吡啶 -2- 基)-2H- 吡唑 -3- 羧酸 [2- 溴 -4- 氯 -6-(1- 环丙基 - 乙基氨基甲酰基)- 苯基]- 酰胺 (M23.4),

[0264] 5- 溴 -2-(3- 氯 - 吡啶 -2- 基)-2H- 吡唑 -3- 羧酸 [2,4- 二氯 -6-(1- 环丙基 - 乙基氨基甲酰基)- 苯基]- 酰胺 (M23.5),

[0265] 5- 溴 -2-(3- 氯 - 吡啶 -2- 基)-2H- 吡唑 -3- 羧酸 [4- 氯 -2-(1- 环丙基 - 乙基氨基甲酰基)-6- 甲基 - 苯基]- 酰胺 (M23.6),

[0266] N′ -(2-{[5- 溴 -2-(3- 氯 - 吡啶 -2- 基)-2H- 吡唑 -3- 羰基]- 氨基 }-5- 氯 -3- 甲基 - 苯甲酰基)- 肼羧酸甲酯 (M23.7),

[0267] N′ -(2-{[5- 溴 -2-(3- 氯 - 吡啶 -2- 基)-2H- 吡唑 -3- 羰基]- 氨基 }-5- 氯 -3- 甲基 - 苯甲酰基)-N′ - 甲基 - 肼羧酸甲酯 (M23.8),

[0268] N′ -(2-{[5- 溴 -2-(3- 氯 - 吡啶 -2- 基)-2H- 吡唑 -3- 羰基]- 氨基 }-5- 氯 -3- 甲基 - 苯甲酰基)-N,N′ - 二甲基 - 肼羧酸甲酯 (M23.9),

[0269] N′ -(3,5- 二溴 -2-{[5- 溴 -2-(3- 氯 - 吡啶 -2- 基)-2H- 吡唑 -3- 羰基]- 氨基 }- 苯甲酰基)- 肼羧酸甲酯 (M23.10),

[0270] N′ -(3,5- 二溴 -2-{[5- 溴 -2-(3- 氯 - 吡啶 -2- 基)-2H- 吡唑 -3- 羰基]- 氨基 }- 苯甲酰基)-N′ - 甲基 - 肼羧酸甲酯 (M23.11) 和

[0271] N′ -(3,5- 二溴 -2-{[5- 溴 -2-(3- 氯 - 吡啶 -2- 基)-2H- 吡唑 -3- 羰基]- 氨基 }- 苯甲酰基)-N,N′ - 二甲基 - 肼羧酸甲酯 (M23.12) ;

[0272] M.24. 丙二腈化合物 :2-(2,2,3,3,4,4,5,5- 八氟戊基)-2-(3,3,3- 三氟 - 丙基) 丙二腈 ($CF_2H-CF_2-CF_2-CF_2-CH_2-C(CN)_2-CH_2-CH_2-CF_3$)(M24.1) 和 2-(2,2,3,3,4,4,5,5- 八氟戊基)-2-(3,3,4,4,4- 五氟丁基)- 丙二腈 ($CF_2H-CF_2-CF_2-CF_2-CH_2-C(CN)_2-CH_2-CH_2-CF_2-CF_3$)

(M24.2)；

[0273] M.25. 微生物破坏剂：苏云金杆菌(Bacillus thuringiensis)亚种Israelensi，球形芽孢杆菌(Bacilluss phaericus)，苏云金芽孢杆菌鲇泽亚种(Bacillus thuringiensis subsp.Aizawai)，苏云金杆菌亚种Kurstaki，苏云金杆菌亚种Tenebrionis；

[0274] M.26. 氨基呋喃酮化合物：

[0275] 4-{[(6-溴吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.1)，

[0276] 4-{[(6-氟吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.2)，

[0277] 4-{[(2-氯1,3-噻唑-5-基)甲基](2-氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.3)，

[0278] 4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.4)，

[0279] 4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.5)，

[0280] 4-{[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](甲基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.6)，

[0281] 4-{[(5,6-二氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.7)，

[0282] 4-{[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](环丙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.8)，

[0283] 4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](环丙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.9)和

[0284] 4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](甲基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(M26.10)；

[0285] M.27. 各种化合物：磷化铝，amidoflumet，benclothiaz，苯螨特(benzoximate)，联苯肼酯(bifenazat e)，硼砂(borax)，溴螨酯(bromopropylate)，氰化物，苯腈吡螨酯(cyenopyrafen)，丁氟螨酯(cyflumetofen)，灭螨猛(chinomethionate)，三氯杀螨醇(dicofol)，氟乙酸盐(酯)，磷化氢，啶虫醚(pyridalyl)，七氟虫酰胺(pyrifluquinazon)，硫磺，有机硫化合物，酒石催吐药，氟啶虫胺腈(sulfoxaflor)，N-R′-2,2-二卤-1-R″环-丙烷甲酰胺-2-(2,6-二氯-α，α，α-三氟-p-甲苯基)腙或N-R′-2,2-二(R′″)丙酰胺-2-(2,6-二氯-α，α，α-三氟-p-甲苯基)-腙，其中R′为甲基或乙基，卤为氯或溴，R″为氢或甲基和R′″为甲基或乙基，4-丁-2-炔基氧基-6-(3,5-二甲基-哌啶-1-基)-2-氟-嘧啶(M27.1)，

[0286] 环丙烷乙酸，1,1′-[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-4-[[(2-环丙基乙酰基)氧基]甲基]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氢-12-羟基-4,6a,12b-三甲基-11-氧代-9-(3-吡啶基)-2H,11H-萘并[2,1-b]吡喃并[3,4-e]吡喃-3,6-二基]酯(M27.2)和

[0287] 8-(2-环丙基甲氧基-4-三氟甲基-苯氧基)-3-(6-三氟甲基-哒嗪-3-基)-3-氮杂-二环[3.2.1]辛烷(M27.3)。

[0288] 组M的商购可得的化合物可以参见The Pesticide Manual，13thEdition，British Crop Protection Council(2003)以及其它公开。

[0289] Lepimectin已知于Agro Project，PJB Publications Ltd，No-vember 2004。Benclothiaz及其制备已经描述于EP-A1454621。杀扑磷(Methidathion)和对氧磷(Paraoxon)及其制备已经描述于Farm Chemicals Handbook，Volume 88，Meister Publishing Company，2001。氰氟虫腙(Metaflumizone)及其制备已经描述于EP-A1 462 456。吡氟硫磷(Flupyrazofos)已描述于Pesticide Science 54，1988，p.237-243和US 4822779。Pyrafluprole及其制备已经描述于JP 2002193709和WO 01/00614。Pyriprole

及其制备已经描述于WO 98/45274和US 6335357。Amidoflumet及其制备已经描述于US 6221890和JP 21010907。Flufenerim及其制备已经描述于WO 03/007717和WO 03/007718。AKD 1022及其制备已经描述于US 6300348。氯虫苯甲酰胺(chloranthraniliprole)已描述于WO 01/70671，WO 03/015519和WO 05/118552。氰虫苯甲酰胺(Cyantranil iprole)已描述于WO 01/70671，WO 04/067528和WO 05/118552。邻氨基苯甲酸内酰胺类M23.1至M23.6已经描述于WO 2008/72743和WO 200872783，那些M23.7至M23.12已经描述与WO2007/043677。邻苯二酰胺M 21.1已知于WO 2007/101540。丁氟螨酯(Cyflumetofen)及其制备已经描述于WO 04/080180。氨基喹唑啉酮化合物七氟虫酰胺(Pyrifluquinazon)已描述于EP A 109 7932。硫砜亚胺氟啶虫胺腈(Sulfoxaflor)已描述于WO 2006/060029和WO 2007/149134。炔基醚化合物M27.1描述于例如JP 2006131529。有机硫化合物已经描述于WO 2007060839。异噁唑啉化合物M 22.1至M 22.5已经描述于例如WO2005/085216，WO 2007/079162和WO 2007/026965。氨基呋喃酮化合物M 26.1至M 26.10已经描述于例如WO 2007/115644。Pyripyropene衍生物M 27.2已描述于WO 2008/66153和WO 2008/108491。哒嗪化合物M 27.3已描述于JP 2008/115155。丙二腈化合物的那些(M24.1)和(M24.2)已经描述于WO 02/089579，WO 02/090320，WO 02/090321，WO 04/006677，WO 05/068423，WO 05/068432和WO 05/063694。

[0290] 杀真菌的混合伴侣是选自下组的那些：酰基丙氨酸如苯霜灵(benalaxyl)，甲霜灵(metalaxyl)，呋酰胺(ofurace)，噁霜灵(oxadixyl)，胺衍生物如aldimorph，多果定(dodine)，十二环吗啉(dodemorph)，丁苯吗啉(fenpropimorph)，苯锈啶(fenpropidin)，双胍辛乙酸盐(guazatine)，双胍辛胺(iminoctadine)，螺环菌胺(spiroxamin)，十三吗啉(tridemorph)，

[0291] 苯胺基嘧啶类如嘧霉胺(pyrimethanil)，嘧菌胺(mepanipyrim)或cyrodinyl，抗生素如放线菌酮(cycloheximid)，灰黄霉素(griseofulvin)，春雷霉素(kasugamycin)，多马霉素(natamycin)，多抗霉素(polyoxin)或链霉素(streptomycin)，

[0292] 唑类如联苯三唑醇(bitertanol)，bromoconazole，环丙唑醇(cyproconazole)，苯醚甲环唑(difenoconazole)，烯唑醇(diniconazole)，氟环唑(epoxiconazole)，腈苯唑(fenbuconazole)，氟喹唑(fluquiconazole)，氟硅唑(flusilazole)，己唑醇(hexaconazole)，抑霉唑(imazalil)，叶菌唑(metconazole)，腈菌唑(myclobutanil)，戊菌唑(penconazole)，丙环唑(propiconazole)，咪酰胺(prochloraz)，丙硫菌唑(prothioconazole)，戊唑醇(tebuconazole)，三唑酮(triadimefon)，三唑醇(triadimenol)，氟菌唑(triflumizol)，灭菌唑(triticonazole)，粉唑醇(flutriafol)，

[0293] 二羧酰亚胺类如异菌脲(iprodion)，甲菌利(myclozolin)，腐霉利(procymidon)，乙烯菌核利(vinclozolin)，

[0294] 二硫代氨基甲酸盐类如福美铁(ferbam)，代森钠(nabam)，代森锰(maneb)，代森锰锌(mancozeb)，威百亩(metam)，代森联(metiram)，丙森锌(propineb)，代森福美锌(polycarbamate)，塞仑(thiram)，福美锌(ziram)，代森锌(zineb)，

[0295] 杂环化合物如敌菌灵(anilazine)，苯菌灵(benomyl)，啶酰菌胺(boscalid)，多菌灵(carbendazim)，萎锈灵(carboxin)，氧化萎锈灵(oxycarboxin)，氰霜唑(cyazofamid)，棉隆(dazomet)，二氰蒽醌(dithianon)，噁唑菌酮(famoxadon)，咪唑菌酮

(fenamidon)，氯苯嘧啶醇 (fenarimol)，麦穗宁 (fuberidazole)，氟酰胺 (flutolanil)，呋吡菌胺 (furametpyr)，稻瘟灵 (isoprothiolane)，灭锈胺 (mepronil)，氟苯嘧啶醇 (nuarimol)，烯丙苯噻唑 (probenazole)，丙氧喹啉 (proquinazid)，啶斑肟 (pyrifenox)，咯喹酮 (pyroquilon)，苯氧喹啉 (quinoxyfen)，硅噻菌胺 (silthiofam)，噻菌灵 (thiabendazole)，噻氟菌胺 (thifluzamid)，甲基硫菌灵 (thiophanate-methyl)，噻酰菌胺 (tiadinil)，三环唑 (tricyclazole)，嗪氨灵 (triforine)，

[0296] 铜类杀真菌剂如波尔多液 (bordeaux mixture)，乙酸铜，王铜 (copper oxychloride)，碱式硫酸铜，

[0297] 硝基苯基衍生物如乐杀螨 (binapacryl)，二硝巴豆酸酯 (dinocap)，消螨通 (dinobuton)，酞菌酯，

[0298] 苯基吡咯类如拌种咯 (fenpiclonil) 或咯菌腈 (fludioxonil)，

[0299] 硫磺，

[0300] 其它杀真菌剂如活化酯 (acibenzolar-S-methyl)，苯噻菌胺酯 (benthiavalicarb)，环丙酰菌胺 (carpropamid)，百菌清 (chlorothalonil)，环氟苄酰胺 (cyflufenamid)，霜脲氰 (cymoxanil)，哒菌酮 (diclomezin)，双氯氰菌胺 (diclocymet)，乙霉威 (diethofencarb)，敌瘟磷 (edifenphos)，噻唑菌胺 (ethaboxam)，环酰菌胺 (fenhexamid)，三苯锡 (fentin)- 乙酸盐，稻瘟酰胺 (fenoxanil)，嘧菌腙 (ferimzone)，氟啶胺 (fluazinam)，三乙膦酸 (fosetyl)，三乙膦酸 (fosetyl)- 铝盐，异丙菌胺 (iprovalicarb)，六氯苯 (hexachlorobenzene)，苯菌酮 (metrafenon)，戊菌隆 (pencycuron)，霜霉威 (propamocarb)，四氯苯酞 (phthalide)，甲基立枯磷 (toloclofos-methyl)，五氯硝基苯 (quintozene)，苯酰菌胺 (zoxamid)，

[0301] 嗜球果伞素类 (strobilurins) 如嘧菌酯 (azoxystrobin)，醚菌胺 (dimoxystrobin)，氟嘧菌酯 (fluoxastrobin)，醚菌酯 (kresoxim-methyl)，苯氧菌胺 (metominostrobin)，肟醚菌胺 (orysastrobin)，啶氧菌酯 (picoxystrobin) 或肟菌酯 (trifloxystrobin)，

[0302] 次磺酸衍生物如敌菌丹 (captafol)，克菌丹 (captan)，苯氟磺胺 (dichlofluanid)，灭菌丹 (folpet)，甲苯氟磺胺 (tolylfluanid)，

[0303] cinnemamides 和类似物如烯酰吗啉 (dimethomorph)，氟酰菌胺 (flumetover) 或氟吗啉 (flumorph)。

[0304] 应用

[0305] 由于它们的优异的活性，所述式 I 化合物可以用于防除动物害虫。据此，本发明也提供防除动物害虫的方法，该方法包括将害虫，它们的食品供给，它们的生境或它们的繁殖场，或者栽培植物，植物繁殖材料（如种子），其中害虫正在生长或可以生长的土壤、区域、材料或环境，或者欲保护以免于害虫攻击或侵染的材料、栽培植物、植物繁殖材料（如种子）、土壤、表面或空间用杀虫有效量的式 I 化合物或其盐或如上定义的组合物处理。

[0306] 优选地，本发明方法保护植物繁殖材料（如种子）和自其生长的植物以免于动物害虫攻击或侵染并且包括将植物繁殖材料（如种子）用杀虫有效量的如上定义的式 I 化合物或其农业上可接受的盐或者用杀虫有效量的如上下文定义的农业组合物处理。本发明方法不限于保护已根据本发明处理的“底物”（植物、植物繁殖材料、土壤材料等），其还具有

预防性效果，例如保护生长自经处理的植物繁殖材料（如种子）的植物，该植物本身并未经过处理。

[0307] 在本发明含义中，“动物害虫”优选地选自节肢动物和线虫类，更优选有害昆虫类、蛛形类和线虫类，甚至更优选昆虫类、螨类和线虫类。

[0308] 本发明还提供对抗上述动物害虫的农业组合物，其包含具有杀虫作用的量的至少一种式 I 化合物或其至少一种农业上有用盐和至少一种惰性液体和 / 或固体农学可接受的载体，和如果希望的至少一种表面活性剂。

[0309] 此种组合物可包含单一活性式 I 化合物或其盐或者根据本发明的数种活性式 I 化合物或它们的盐的混合物。根据本发明的组合物可包含各个异构体或异构体混合物以及各个互变异构体或互变异构体的混合物。

[0310] 动物害虫即昆虫类、蛛形类和线虫类，植物、土壤或植物生长于其中的水能够通过本领域中已知的任意施用方法与式 I 化合物或含有它们的组合物接触。就此，“接触”包括直接接触（将所述化合物 / 组合物直接施用在动物害虫或植物上 - 典型地施用至植物的叶、茎干或根）和间接接触（将所述化合物 / 组合物施用至动物害虫或植物的所在地）。

[0311] 可以通过将植物 / 作物与杀虫有效量的式 I 化合物接触用式 I 化合物或包含它们的杀虫组合物来保护生长植物和农作物以免于动物害虫特别是昆虫类、螨类或蛛形类的攻击或侵染。术语“作物”是指生长中的农作物和收获的农作物。

[0312] 本发明化合物和包含它们的组合物在防除各种栽培植物上的许多昆虫类中是特别地重要的，所述各种栽培植物如禾谷类，根用作物，油科作物，蔬菜，香料植物，观赏植物，例如硬粒小麦和其它小麦的种子，大麦，燕麦，黑麦，玉米（饲用玉米和糖玉米 / 甜玉米和饲料玉米），大豆，油科作物，十字花科植物，棉花，向日葵，香蕉，稻，油菜，芜菁油菜，甜菜，饲料甜菜，茄子，马铃薯，禾本科草，草坪，草皮，饲料用草，番茄，韭葱，南瓜 (pumpkin)/ 南瓜 (squash)，卷心菜，冰山莴苣，胡椒，黄瓜，瓜类，芸苔植物，瓜类，豆类，豌豆，蒜，洋葱，胡萝卜，块茎植物如马铃薯，甘蔗，烟草，葡萄，矮牵牛，老鹳草 / 天竺葵，三色堇和凤仙花。

[0313] 本发明化合物原样或以组合物形式使用 :通过将昆虫类或欲保护以免于昆虫攻击的植物、植物繁殖材料如种子、土壤、表面、材料或房间用杀昆虫有效量的活性化合物处理。该应用能够在昆虫感染植物、植物繁殖材料如种子、土壤、表面、材料或房间之前和之后进行。

[0314] 本发明也包括对抗动物害虫的方法，其包括将动物害虫、它们的生境、繁殖场、其中所述动物害虫正在生长或可以生长的食品供给、栽培植物、种子、土壤、区域、材料或环境，或者欲保护以免于动物攻击或侵染的材料、植物、种子、土壤、表面或空间与杀虫有效量的至少一种活性式 I 化合物的混合物相接触。

[0315] 此外，动物害虫可以通过将靶标害虫其食品供给、生境、繁殖场或其所在地与杀虫有效量的式 I 化合物接触来防除。就此，该应用可以在害虫感染所在地、生长农作物或收获的农作物之前或之后进行。

[0316] 本发明的化合物还可以预防性地施用至预期存在害虫的场所。

[0317] 式 I 化合物也可以通过将植物与杀虫有效量的式 I 化合物接触用来保护生长中的植物免于害虫攻击或侵染。就此，" 接触 " 包括直接接触（将所述化合物 / 组合物直接施用至害虫和 / 或植物上 - 典型地施用至植物的叶、茎干或根）和间接接触（将所述化合物

/ 组合物施用至害虫和 / 或植物的所在地)。

[0318] “所在地”意指其中害虫或寄生物正在生长或可以生长的生境、繁殖场、植物、种子、土壤、区域、材料或环境。

[0319] 术语“植物繁殖材料”应理解为表示植物的全部繁殖性部分如种子和可用于植物繁殖的植物性植物材料如扦插和块茎 (例如马铃薯)。它们包括种子,根,果实,块茎,鳞茎,根茎,新枝,芽和植物的其它部分。还可以包括待在发芽之后或在自土壤出苗之后移植的幼苗和幼小植物。这些植物繁殖材料可以用植物保护化合物在种植或移植之时或之前预防地处理。

[0320] 术语“栽培植物”理解为包括已经通过育种、引起突变或基因工程修饰的植物。基因改性的植物是植物,其遗传材料已经通过使用重组 DNA 技术修饰,而且经这样修饰的遗传材料在天然环境下不能通过杂交、突变或天然重组容易地获得。典型地,已将一个或多个基因整合入基因改性植物的遗传材料以改良植物的特定性质。此种基因修饰也包括但不限于蛋白 (寡肽或多肽) 的靶向后过渡性修饰,例如通过糖基化或聚合物加成如异戊二烯基化、乙酰化或法呢基化部分或 PEG 部分 (例如 Biotechnol Prog. 2001 Jul-Aug ; 17(4) :720-8. , Protein Eng Des Sel. 2004 Jan ;17(1) :57-66, Nat Protoc. 2007 ; 2(5) :1225-35. , Curr Opin Chem Biol. 2006 Oct ;10(5) :487-91. Epub 2006 Aug 28. , Biomaterials. 2001 Mar ;22(5) :405-17, Bioconjug Chem. 2005 Jan-Feb ;16(1) :113-21 的公开)。

[0321] 术语“栽培植物”应理解也包括作为常规育种方法或基因工程的结果已经使之耐受施用特定类除草剂的植物,所述除草剂如羟基 - 苯基丙酮酸双氧酶 (HPPD) 抑制剂 ; 乙酰乳酸合酶 (ALS) 抑制剂,如磺酰基脲类 (参见例如 US 6,222,100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/02526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073) 或咪唑啉酮类 (参见例如 US 6,222,100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/02526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073) ; 烯醇丙酮基莽草酸 -3- 磷酸合酶 (EPSPS) 抑制剂,如草甘膦 (glyphosate)(参见例如 WO 92/00377) ;谷氨酰胺合成酶 (GS) 抑制剂,如草铵膦 (glufosinate)(参见例如 EP-A-0242236, EP-A-242246) 或 oxynil 除草剂 (参见例如 US 5,559,024)。已经通过常规育种方法 (引起突变) 使得数栽培植物耐受除草剂,例如 Clearfield® 夏播油菜 (Canola) 耐受咪唑啉酮类,例如甲氧咪草烟 (imazamox)。已经用基因工程方法来使栽培植物如大豆、棉花、玉米、甜菜和油菜耐受除草剂如草甘膦和草铵膦,其中某些可以按商品名 RoundupReady® (草甘膦) 和 LibertyLink® (草铵膦) 商购。

[0322] 术语“栽培植物”应理解也包括通过使用重组 DNA 技术使之能合成下述的植物 : 一种或多种杀昆虫蛋白,特别是已知于细菌芽孢杆菌属 (Bacillus),特别是苏云金杆菌的那些杀昆虫蛋白,如ä - 内毒素,例如 CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) 或 Cry9c ;植物性杀昆虫蛋白 (VIP),例如 VIP1, VIP2, VIP3 或 VIP3A ; 定居线虫类的细菌的杀昆虫蛋白,所述细菌是例如光杆状菌属 (photorhabdus spp.) 或致病杆菌属 (Xenorhabdus spp.) ;动物产生的毒素,如蝎毒素、蜘蛛毒素、蜂毒素或其它昆虫 - 特异性神经毒素 ;真菌产生的毒素,如链霉菌毒素,植物凝集素,如豌豆或大麦外源

凝集素；凝集素；蛋白酶抑制剂，如胰蛋白酶抑制剂，丝氨酸蛋白酶抑制剂，patatin，半胱氨酸蛋白酶抑制剂或木瓜蛋白酶抑制剂；核糖体失活蛋白（RIP），如蓖麻毒素，玉米-RIP，相思豆毒蛋白，软瓜蛋白，肥皂草毒蛋白或异株泻根毒蛋白；甾族化合物代谢酶，如3-羟基甾族化合物氧化酶，蜕皮甾类-IDP-糖基-转移酶，胆甾醇氧化酶，蜕皮素抑制剂或HMG-CoA-还原酶；离子通道阻断剂，如钠或钙通道阻断剂；保幼激素酯激酶；利尿激素受体（helicokinin receptors）；stilben合酶，联苄合酶，几丁质酶或葡聚糖酶。在本发明的上下文中，这些杀昆虫蛋白或毒素也应清楚地理解为前毒素、杂交蛋白、截短蛋白或修饰蛋白。杂交蛋白的特征是蛋白域的新组合（参见，例如WO 02/015701）。此种毒素或能够合成此种毒素的基因工程改造的植物的其它实例公开于例如EP-A 374 753，WO 93/007278，WO 95/34656，EP-A 427 529，EP-A 451 878，WO 03/018810和WO 03/052073。产生此种基因改性的植物的方法是本领域技术人员普遍已知的，并且描述于例如上文提及的出版物中。包含于基因改性的植物中的这些杀昆虫蛋白为产生这些蛋白的植物提供保护以免于节肢动物具体分组的有害害虫，特别是甲虫类（鞘翅目（Coleoptera）），蝇（双翅目（Diptera）），和蝴蝶和蛾类（鳞翅目（Lepidoptera））和植物寄生性线虫类（线虫纲（Nematoda））的侵袭。

[0323] 术语“栽培植物”应理解也包括通过使用重组DNA技术使之能合成一种或多种蛋白以增加那些植物对细菌、病毒或真菌病原体的抗性或耐受性的植物。此种蛋白的实例是所谓“病程相关蛋白”（PR蛋白，参见例如EP-A 0 392 225），植物病害抗性基因（例如马铃薯栽培种，其表达对衍生自墨西哥野生Solanum bulbocastanum的致病疫霉（Phytophthora infestans）起作用的抗性基因）或T4-溶菌酶（例如能够合成这些蛋白的马铃薯栽培种，其具有针对细菌如解淀粉杆菌（Erwinia amylvora）的提高的抗性）。产生此种基因改性的植物的方法是本领域技术人员普遍已知的，并且描述于例如以上提及的出版物中。

[0324] 术语“栽培植物”应理解也包括通过使用重组DNA技术使之能合成一种或多种蛋白的植物，其增加生产能力（例如生物量生产，谷物收获，淀粉含量，油含量或蛋白含量），对干旱、盐度或其它生长-限制性环境因素的耐受性或者对那些植物的害虫和真菌、细菌或病毒病原体的耐受性。

[0325] 术语“栽培植物”应理解也包括通过使用重组DNA技术使之含有特别是改良人或动物营养的修饰量的内含物质或新内含物质的植物，例如产生健康促进性长链ω-3脂肪酸或不饱和的ω-9脂肪酸的油科作物（例如Nexera®油菜）。

[0326] 术语“栽培植物”应理解也包括通过使用重组DNA技术使之含有特别是改良原料产生的修饰量内含物质或新内含物质的植物，例如产生提高量的支链淀粉的马铃薯（例如Amflora®马铃薯）。

[0327] 一般而言，“杀虫有效量”意指实现对生长的可观察效果所需要的活性成分的量，所述可观察效果包括坏死、死亡、阻滞、预防和除去、破坏或者减少靶标有机体的存在和活性的效果。对于本发明所用的各种化合物/组合物来说，杀虫有效量可以变化。杀虫有效量的所述组合物也根据主要条件而变化，如希望的杀虫效果和持续时间，气候，靶标种类，所在地，施用模式等。

[0328] 在土壤处理或施用至害虫栖息地或巢穴的情况下，活性成分的量的范围是0.0001至500g每100m^2，优选0.001至20g每100m^2。

[0329] 材料保护中的常规施用量是例如 0.01g 至 1000g 活性化合物每 m^2 经处理材料，优选 0.1g 至 50g 每 m^2。

[0330] 用于浸渗材料的杀昆虫组合物典型地含有 0.001 至 95 重量%，优选 0.1 至 45 重量%，更优选 1 至 25 重量%的至少一种驱避剂和 / 或杀昆虫剂。

[0331] 为了用于处理作物植物，本发明活性成分的施用量可以是 0.1g 至 4000g 每公顷，优选 25g 至 600g 每公顷，更优选 50g 至 500g 每公顷。

[0332] 式 I 化合物通过接触（经由土壤、玻璃、墙壁、床帐、地毯，植物部分或动物部分），和摄食（饵剂或植物部分）均有效。

[0333] 本发明的化合物还可以施用以对抗非作物昆虫害虫，如蚂蚁、白蚁、胡蜂、蝇、蚊、蟋蟀、或蜚蠊。为了用来对抗所述非作物害虫，式 I 化合物优选以饵剂组合物使用。

[0334] 饵剂可以是液体、固体或半固体制剂（例如凝胶）。固体饵料能够形成适宜的各施用的各种形状和形式例如颗粒状、块状、棒状、盘状。可以将液体饵料充入各种装置以确保合适的施用，例如开口容器、喷雾装置、微滴来源或蒸发来源。凝胶可以基于含水或含油基质，并能够配制成粘性、水分保留或老化特性方面的特别必需品。

[0335] 所述组合物中采用的饵剂是这样的产品，其具有足够吸引力以引诱昆虫类如蚂蚁、白蚁类、胡蜂、蝇、蚊、蟋蟀等或蜚蠊来食用它。能用进食刺激剂或性别信息素来调节吸引力。例如，食物刺激剂不排它地选自动物和 / 或植物蛋白（肉粉、鱼粉或血粉，昆虫部分，蛋黄），动物和 / 或植物来源的脂肪和油，或有机单糖，低聚糖或多聚糖，特别是蔗糖、乳糖、果糖、葡萄糖、葡萄糖、淀粉、果胶或甚至浓缩糖蜜或蜂蜜。果实、农作物、植物、动物、昆虫类或其特定部分的新鲜或腐败部分还能够充当进食刺激剂。性别信息素已知是更加昆虫特异性的。特定的信息素描述于文献中并是本领域技术人员已知的。

[0336] 为了用于饵剂组合物，活性成分的典型的含量是 0.001 重量%至 15 重量%，优选 0.001 重量%至 5%重量%的活性化合物。

[0337] 式 I 化合物的气雾剂（例如在喷雾罐中）、油喷雾剂或泵式喷雾剂配制剂高度适于非专业用户防除害虫如蝇、蚤、蜱、蚊或蜚蠊。气雾剂配方优选包括活性化合物，溶剂如低级醇类（例如甲醇，乙醇，丙醇，丁醇），酮类（例如丙酮，甲基乙基酮），具有约 50 至 250℃沸程的石蜡烃（例如煤油），二甲基甲酰胺，N- 甲基吡咯烷酮，二甲亚砜，芳族烃如甲苯、二甲苯，水，其它助剂比如乳化剂，如山梨醇单油酸酯，具有 3-7mol 环氧乙烷的油烯基乙氧基化物，脂肪醇乙氧基化物，香料油如醚油，中链脂肪酸与低级醇的酯，芳族羰基化合物，如果适当的稳定剂如苯甲酸钠，两性表面活性剂，低级环氧化物，三原甲酸乙酯，和如果需要的推进剂如丙烷，丁烷，氮，压缩空气，二甲醚，二氧化碳，氧化亚氮，或者这些气体的混合物。

[0338] 油喷雾配制剂不同于气雾剂配方之处是不使用推进剂。

[0339] 为了用于喷雾组合物，活性成分的含量是 0.001 至 80 重量%，优选 0.01 至 50 重量%和最优选 0.01 至 15 重量%。

[0340] 式 I 化合物及其各组合物还可以用于蚊香和熏香、发烟筒、汽化板或长期汽化器，以及防蛀纸、防蛀垫或其它不依赖热的汽化器系统。

[0341] 用式 I 化合物及其各组合物防除昆虫传播的传染性疾病的方法（例如疟疾、登革热和黄热病，淋巴丝虫病和利什曼病）也包括处理屋舍和住宅表面，空气喷洒和浸渗帘幕、帐篷、衣物、床帐、捕蝇笼等。用来施用至纤维、织物、编织物、无纺织物、网状材料或箔材

和帆布的杀昆虫组合物优选包含混合物，该混合物包括杀昆虫剂、任选的驱避剂和至少一种粘合剂。适宜的驱避剂是例如 N，N- 二乙基 - 间 - 苯甲酰胺 (DEET)，N，N- 二乙基 N- 乙酰苯胺 (DEPA)，1-(3- 环己 -1- 基 - 羰基)-2- 甲基胡椒碱，(2- 羟甲基环己基) 乙酸内酯，2- 乙基 -1，3- 己二醇，避蚊酮 (indalone)，甲基新癸酰胺 (MNDA)，不用于昆虫防除的拟除虫菊酯如 {(+/-)-3- 烯丙基 -2- 甲基 -4- 氧代环戊 -2-(+)- 烯基 -(+)- 反式 - 菊酸酯 (Es- 生物烯丙菊酯)，衍生自或等同于植物提取物的驱避剂比如来自植物比如斑皮桉 (Eucalyptus maculata)，单叶蔓荆 (Vitex rotundifolia)，Cymbopogan martinli，香茅 (Cymbopogan citratus)(柠檬草)，亚香茅 (Cymopogan nartdus)(香茅) 的苧烯，丁子香酚，(+)-Eucamalol(1)，(-)-1- 表 -eucamalol 或粗制植物提取物。适宜的粘合剂选自例如脂族酸乙烯基酯的聚合物和共聚物 (如乙酸乙烯酯和叔碳酸乙烯酯 (vinyl versatate))，醇的丙烯酸和甲基丙烯酸酯，如丙烯酸丁酯，2- 乙基己基丙烯酸酯，和丙烯酸甲酯，单烯式和二烯式不饱和的烃如苯乙烯，和脂族双烯烃如丁二烯。

[0342] 浸渗帘幕和床帐一般通过将纺织品材料浸入杀昆虫剂乳液或分散液或将其喷洒至网帐上来完成。

[0343] 式 I 化合物及其组合物可用于保护木质材料如树、木板栅栏、枕木、等，以及建筑如住宅、附属建筑、工厂，以及建筑材料、家具、皮革、纤维、乙烯基制品、电线和线缆等免于蚂蚁和 / 或白蚁侵袭，并且用于防除蚂蚁和白蚁免于损害农作物或人类 (例如在害虫侵入住宅和公共设施的情况下)。式 I 化合物不仅施用至周围土壤表面或施用入地板下土壤以保护木质材料，其还可以施用至木制品如地板下混凝土表面、壁凹柱、大梁、胶合板、家具等，木制品如刨花板、半板 (half boards) 等和乙烯基制品如包膜电线，乙烯基片材，绝热材料如苯乙烯泡沫等。在施用以对抗蚂蚁损害农作物或人类的情况下，将本发明的蚂蚁防除剂施用至农作物或周围土壤，或者直接施用至蚂蚁巢穴等。

[0344] 种子处理

[0345] 式 I 化合物也适于处理种子以保护种子免于昆虫害虫特别是土生昆虫害虫侵袭以及保护所获得的植物的根和新枝以对抗土壤害虫和叶面昆虫。

[0346] 式 I 化合物特别有用地保护种子免于土壤害虫侵袭以及保护所获得的植物的根和新枝对抗土壤害虫和叶面昆虫。保护所获得的植物的根和新枝是优选的。更优选的是保护所得植物的新枝免于穿刺和吮吸昆虫侵袭，其中保护以免于蚜虫类侵袭是最优选的。

[0347] 因此，本发明包括保护种子免于昆虫，特别是免于土壤昆虫侵袭以及保护幼苗的根和新枝免于昆虫，特别是免于土壤和叶面昆虫侵袭的方法，所述方法包括将种子在播种之前和 / 或在催芽之后与通式 I 化合物或其盐接触。特别地优选的是这样的方法，其中植物的根和新枝得以保护，更优选这样的方法，其中植物新枝得以保护以免于钻孔和吮汁昆虫侵袭，最优选这样的方法，其中植物新枝得以保护以免于蚜虫类侵袭。

[0348] 术语种子包涵种子和全部种类的植物繁殖体包括但不限于，有性种子，种块，根蘖，球茎，鳞茎，果实，块茎，谷粒，扦插，伐条等，并且在优选的实施方式中意指有性种子。

[0349] 术语种子处理包含本技术领域中已知的全部适宜的种子处理，如拌种、种子包衣、种子喷粉、浸种和种子制粒。

[0350] 本发明还包含含有活性化合物或用其包衣的种子。

[0351] 术语“用…包衣和 / 或含有”一般地表示活性成分在施用时绝大部分在繁殖产品

的表面，尽管取决于施用方法成分中或多或少部分可以透入繁殖产品。在所述繁殖产品（再）种植的情况下，其可以吸收活性成分。

[0352] 适宜的种子是下述种子：谷物，根用作物，油科作物，蔬菜，调味植物，观赏植物，例如硬粒小麦和其它小麦的种子，大麦，燕麦，黑麦，玉米（饲用玉米和糖用玉米/甜玉米和饲料玉米），大豆，油科作物，十字花科植物，棉花，向日葵，香蕉，稻，油菜，芜菁油菜，甜菜，饲料甜菜，茄子，马铃薯，禾本科草，草坪，草皮，饲料用草，番茄，韭葱，南瓜（pumpkin）/南瓜（squash），卷心菜，冰山莴苣，胡椒，黄瓜，瓜类，芸苔植物，瓜类，豆类，豌豆，蒜，洋葱，胡萝卜，块茎植物如马铃薯，甘蔗，烟草，葡萄，矮牵牛，老鹳草/天竺葵，三色堇和凤仙花。

[0353] 另外，活性化合物还可用于处理来自植物的种子，所述种子由于包括基因工程的育种方法而耐受除草剂或杀真菌剂或杀昆虫剂的作用。

[0354] 例如，活性化合物能够用来处理来自植物的种子，其对下组除草剂有抗性：磺酰脲类，咪唑啉酮类，草铵膦或草甘膦-异丙基铵盐和类似的活性物质（参见例如，EP-A-0242236，EP-A-242246）（WO 92/00377）（EP-A-0257993，U.S.Pat.No.5,013,659）或者用于处理转基因作物植物，例如具有产生使得植物抗特定害虫（EP-A-0142924，EP-A-0193259）的苏云金杆菌毒素（Bt毒素）能力的棉花。

[0355] 此外，活性化合物也可以用于处理来自植物的与现有植物相比具有经修饰特性的种子，其可以例如通过传统育种方法和/或产生突变或者重组方法产生。例如，已描述了许多情况，其中为修饰植物中合成淀粉的意图重组修饰作物植物（例如WO 92/11376，WO 92/14827，WO 91/19806）或者具有修饰的脂肪酸组成的转基因作物植物（WO 91/13972）。

[0356] 施用活性化合物的种子处理在植物播种之前和在植物出苗之前通过喷洒或喷粉种子而进行。

[0357] 对种子处理剂特别有用的组合物是例如：

[0358] A 可溶性浓缩物（SL，LS）

[0359] D 乳液（EW，EO，ES）

[0360] E 悬浮液（SC，OD，FS）

[0361] F 水可分散性粒剂和水溶性颗粒剂（WG，SG）

[0362] G 水可分散性粉末和水可溶性粉剂（WP，SP，WS）

[0363] H 凝胶-配制剂（GF）

[0364] I 粉剂（DP，DS）

[0365] 常规种子处理剂配制剂包括例如悬浮种衣剂FS，溶液LS，干粉处理剂DS，用于浆料处理的水分散粉剂WS，水可溶性粉剂SS和乳液ES和EC和凝胶配制剂GF。这些配制剂能够施用至稀释或未经稀释地种子。对种子的施用在播种之前进行，其中直接施用至种子或在种子催芽之后施用。

[0366] 在优选的实施方式中，FS配制剂用于种子处理。典型地，FS配制剂可包含1-800g/l活性成分，1-200g/l表面活性剂，0至200g/l抗凝剂，0至400g/l粘合剂，0至200g/l颜料和直至1升溶剂，优选水。

[0367] 用于种子处理特别优选的式I化合物的FS配制剂通常包含0.1至80重量%（1至800g/l）活性成分，0.1至20重量%（1至200g/l）至少一种表面活性剂，例如0.05至5重量%的湿润剂和0.5至15重量%的分散试剂，直至20重量%，例如5至20%的抗凝剂，

0 至 15 重量%，例如 1 至 15 重量%的颜料和 / 或染料，0 至 40 重量%，例如 1 至 40 重量%的粘合剂（粘着剂 / 粘连剂），任选地直至 5 重量%，例如 0.1 至 5 重量%的增稠剂，任选地 0.1 至 2%的消泡剂，和任选地保藏剂如杀生物剂、抗氧化剂等，例如 0.01 至 1 重量%的量，以及直至 100 重量%的填料 / 媒介物。

[0368] 种子处理剂配制剂可以额外地包含粘合剂和任选地着色剂。

[0369] 可以加入粘合剂以改良在处理之后活性材料在种子上的粘着。适宜的粘合剂是环氧烷烃比如环氧乙烷或环氧丙烷的均聚物和共聚物，聚乙酸乙烯酯，聚乙烯醇，聚乙烯吡咯烷酮类及其共聚物，乙烯 - 乙酸乙烯酯共聚物，丙烯酸均聚物和共聚物，聚乙烯胺类，聚乙烯酰胺类和聚乙烯亚胺，多糖类如纤维素、甲基纤维素和淀粉，聚烯烃均聚物和共聚物如烯烃 / 马来酸酐共聚物，聚氨酯，聚酯，聚苯乙烯均聚物和共聚物。

[0370] 任选地，着色剂也可以包括在配制剂中。用于种子处理剂配制剂的适宜着色剂或染料是罗丹明 B，C.I. 颜料红 112，C.I. 溶剂红 1，颜料蓝 15:4，颜料蓝 15:3，颜料蓝 15:2，颜料蓝 15:1，颜料蓝 80，颜料黄 1，颜料黄 13，颜料红 112，颜料红 48:2，颜料红 48:1，颜料红 57:1，颜料红 53:1，颜料橙 43，颜料橙 34，颜料橙 5，颜料绿 36，颜料绿 7，颜料白 6，颜料褐 25，碱性紫 10，碱性紫 49，酸性红 51，酸性红 52，酸性红 14，酸性蓝 9，酸性黄 23，碱性红 10，碱性红 108。

[0371] 成胶剂的实例是角叉菜 (Satiagel®)

[0372] 在种子处理中，所述化合物 I 的施用量一般是 0.1g 至 10kg 每 100kg 种子，优选 1g 至 5kg 每 100kg 种子，更优选 1g 至 1000g 每 100kg 种子，特别是 1g 至 200g 每 100kg 种子。

[0373] 因此，本发明还涉及包含如本文所定义的式 I 化合物或 I 的农业上有用盐的种子。化合物 I 或其农业上有用盐的量一般是 0.1g 至 10kg 每 100kg 种子，优选 1g 至 5kg 每 100kg 种子，特别是 1g 至 1000g 每 100kg 种子。对于特定的农作物如莴苣，用量可以更高。

[0374] 动物健康应用

[0375] 式 I 化合物或其对映异构体或兽医学可接受的盐也特别有效地对抗动物体内和体表的寄生虫。

[0376] 因此，本发明的主题也提供防除动物体内和体表寄生虫的新方法。本发明的又一目的是提供更安全的动物杀虫剂。本发明又一目的是进一步提供具改良效能的动物杀虫剂，其可以以比现有杀虫剂更低的剂量使用。另外，本发明又一目的是提供动物杀虫剂，其提供长期留存的寄生虫防除作用。

[0377] 本发明还涉及含有杀寄生虫有效量的式 I 化合物或其对映异构体或兽医学可接受的盐和可接受的载体的组合物，用于对抗动物体内和体表寄生虫。

[0378] 本发明也提供用于处理、防除、防止和保护动物对抗寄生虫侵染和感染的方法，其包括经口、局部地或肠胃外地施用或者向动物施用杀寄生虫有效量的一种或多种式 I 化合物，或其对映异构体或兽医学可接受的盐，或包含所述化合物的组合物。

[0379] 本发明也提供用于处理、防除、防止和保护动物对抗寄生虫侵染和感染的非治疗性方法，其包括向所在地施用杀寄生虫有效量的式 I 化合物或其对映异构体或兽医学可接受的盐或包含它的组合物。

[0380] 在另一实施方式中，本发明提供用于对抗动物体内和体表寄生虫的组合物，其包含杀寄生虫有效量的一种或多种式 I 化合物，或其对映异构体或兽医学可接受的盐，以及

一种或多种其它活性剂和可接受的载体。本发明还提供用于处理、防除、防止和保护动物对抗寄生虫侵染和感染的方法，其包括施用有效量的一种或多种式 I 化合物以及其它活性剂。

[0381] 本发明也提供制备用于处理、防除、防止或保护动物对抗寄生虫侵染或感染的组合物的方法，其包括将杀寄生虫有效量的式 I 化合物或其对映异构体或兽医学可接受的盐包括在包含它的组合物中。

[0382] 本发明还涉及式 I 化合物用于处理、防除、防止或保护动物对抗寄生虫侵染或感染的用途。

[0383] 本发明还涉及式 I 化合物或包含它的组合物用于制备治疗性处理动物对抗寄生虫的侵染或侵袭的药物的用途。

[0384] 化合物对抗农业的害虫的活性不表明它们防除动物体内和体表内外寄生虫的适用性，所述防除需要例如在口服施用情况下的低非催吐剂量，与动物的代谢相容性，低毒性，安全处理。此外，本领域技术人员应明了，在用来对抗动物体内和体表寄生虫的情况下，本发明化合物的吸附、分布、代谢和消除基于所述化合物在农业应用中的有效性是不可预测的。

[0385] 令人惊奇地，现今发现式 I 化合物有效地对抗动物体内和体表的内外寄生虫。

[0386] 式 I 化合物或其对映异构体或兽医学可接受的盐和包含它们的组合物优选用于防除和防止侵染和感染动物包括温血动物（包括人类）、鸟和鱼。例如，它们适于防除和防止哺乳动物如牛、绵羊、猪、骆驼、鹿、马、猪、家禽、兔子、山羊、狗和猫、水牛、驴、小鹿和驯鹿，以及裘皮用动物如水貂、毛丝鼠和浣熊，鸟类如鸡、鹅、火鸡和鸭，以及鱼类如淡水鱼和咸水鱼，如鳟鱼、鲤鱼和鳗鱼，中的侵染和感染。

[0387] 式 I 化合物或其对映异构体或兽医学可接受的盐和包含它们的组合物优选地用于防除和防止侵染和感染动物包括温血动物（排除人类）、鸟和鱼。例如，它们适于防除和防止除人类外的哺乳动物的侵染和感染。

[0388] 式 I 化合物或其对映异构体或兽医学可接受的盐和包含它们的组合物优选用于防除和防止家畜如狗或猫中的侵染和感染。

[0389] 温血动物和鱼中的侵扰生物包括但不限于虱，咬虱，蜱，鼻肤蝇幼虫，羊蜱蝇，螯蝇，家蝇，蝇，蝇蛆，恙螨，蚋，蚊和蚤。

[0390] 式 I 化合物或其对映异构体或兽医学可接受的盐和包含它们的组合物对内吸性和 / 或非内吸性防除外源和 / 或内寄生虫是有效的。它们对发育的全部或某些阶段有活性。

[0391] 式 I 化合物特别有用地对抗外寄生虫。在处理对抗外寄生虫的各种实施方式中，所述外寄生虫是一种或多种昆虫或蜘蛛，包括栉首蚤属 (Ctenocephalides)，扇头蜱属 (Rhipicephalus)，革蜱属 (Dermacentor)，硬蜱属 (Ixodes)，牛蜱属 (Boophilus)，花蜱属 (Ambylomma)，血蜱属 (Haemaphysalis)，璃眼蜱属 (Hyalomma)，疥螨属 (Sarcoptes)，瘙螨属 (Psoroptes)，耳螨属 (Otodectes)，痒螨属 (Chorioptes)，皮蝇属 (Hypoderma)，畜虱属 (Damalinia)，长颚虱属 (Linognathus)，血虱属 (Haematopinus)，Solenoptes，嚼虱属 (Trichodectes)，和猫羽虱属 (Felicola)。经处理的外寄生虫包括但不限于蚤，蜱，螨，蚊，蝇，虱，丽蝇及其组合。

[0392] 式 I 化合物特别有用地对抗内寄生虫。式 I 化合物对其活性的内寄生虫包括

蠕虫如裸头绦虫属 (Anaplocephala)，钩口线虫属 (Ancylostoma)，Anecator，蛔虫属 (Ascaris)，毛细线虫属 (Capillaria)，古柏线虫属 (Cooperia)，复孔属 (Dipylidium)，恶丝虫属 (Dirofilaria)，棘球属 (Echinococcus)，蛲虫属 (Enterobius)，吸虫属 (Fasciola)，血矛线虫 (Haemonchus)，Oesophagostumum，奥斯特线虫属 (Ostertagia)，弓蛔虫属 (Toxocara)，类圆线虫属 (Strongyloides)，弓蛔线虫属 (Toxascaris)，毛线虫属 (Trichinella)，鞭虫属 (Trichuris)，和毛圆线虫属 (Trichostrongylus)。

[0393] 式 I 化合物特别有用地分别对抗以下寄生虫：

[0394] 等足目 (Isopoda)，例如潮虫 (Oniscus asellus)，Armadillidium vulgare 和鼠妇 (Porcellio scaber)；

[0395] 唇足纲 (Chilopoda)，例如 Geophilus carpophagus 和蚰蜒属 (Scutigera spp.)；

[0396] 综合纲 (Symphyla)，例如白松虫 (Scutigerella immaculata)；

[0397] 弹尾目 (Collembola)，例如武装棘跳虫 (棘跳虫属 (Onychiurus)armatus)；

[0398] 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) 和胡蜂属 (Vespa spp.)；

[0399] Bivalva，例如，饰贝属 (Dreissena spp.)；

[0400] 鞘翅目 (Coleoptera)，例如，菜豆象 (Acanthoscelides obtectus)，喙丽金龟属 (Adoretus spp.)，蓝毛臀萤叶甲 (Agelastica alni)，叩甲属 (Agriotes spp.)，马铃薯鳃金龟 (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 (Apogonia spp.)，隐食甲属 (Atomaria spp.)，毛皮蠹属 (Attagenus spp.)，Bruchidius obtectus，豆象属 (Bruchus spp.)，龟象属 (Ceuthorhynchus spp.)，卑微楔象虫 (Cleonus mendicus)，宽胸叩甲属 (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)，褐小蠹属 (Hypothenemus spp.)，甘蔗大褐齿爪鳃金龟 (Lachnosterna consanguinea)，马铃薯叶甲 (Leptinotarsa decemlineata)，稻水象 (Lissorhoptrus oryzophilus)，筒喙象属 (Lixus spp.)，粉蠹属 (Lyctus spp.)，Meligethes aeneus，五月鳃金龟 (Melolontha melolontha)，Migdolus spp.，墨天牛属 (Monochamus spp.)，Naupactus xanthographus，黄蛛甲 (Niptus hololeucus)，椰蛀犀金龟 (Oryctes rhinoceros)，锯谷盗 (Oryzaephilus surinamensis)，黑葡萄耳象 (Otiorrhynchus sulcatus)，小青花金龟 (Oxycetonia jucunda)，辣根猿叶甲 (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)，米象属 (Sitophilus spp.)，尖隐喙象属 (Sphenophorus spp.)，茎干象属 (Sternechus spp.)，综合目 (Symphyletes spp.)，黄粉甲 (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.)；

[0401] 蚤类(蚤目),例如猫栉首蚤,犬栉首蚤,印鼠客蚤和角叶蚤属,人蚤,穿皮潜蚤,和具带病蚤；

[0402] 蜚蠊(蜚蠊目(Blattaria)-蜚蠊目(Blattodea)),例如德国小蠊(Blattella germanica),Blattella asahinae,美洲大蠊(Periplaneta americana),日本大蠊(Periplaneta japan),褐斑大蠊(Periplaneta brunnea),黑胸大蠊(Periplaneta fuligginosa),澳洲大蠊(Periplaneta australasiae),和东方蜚蠊(Blatta orientalis)；

[0403] 蝇、蚊(双翅目(Diptera)),例如伊蚊属(Aedes spp.),如埃及伊蚊(Aedes aegypti),白条伊蚊(Aedes albopictus),刺扰伊蚊(Aedes vexans),墨西哥按实蝇(Anastrepha ludens),按蚊属(Anopheles)比如五斑按蚊(Anopheles maculipennis),花园毛蚊(Bibio hortulanus),Anopheles crucians,Anopheles albimanus,冈比亚按蚊(Anopheles gambiae),Anopheles freeborni,Anopheles leucosphyrus,微小按蚊(Anopheles minimus),四斑按蚊(Anopheles quadrimaculatus),Calliphora erythrocephala,红头丽蝇(Calliphora vicina),蛆症金蝇(Chrysomya bezziana),Chrysomya hominivorax,Chrysomya macellaria,Chrysops discalis,Chrysops silacea,Chrysops atlanticus,锥蝇属(Cochliomyia spp.)嗜人锥蝇(Cochliomyia hominivorax),噬人瘤蝇(Cordylobia anthropo-phaga),Culicoides furens,库蚊属(Culex spp.)如尖音库蚊(Culex pipiens),Culex nigripalpus,致倦库蚊(Culex quinquefascia-tus),Culex tarsalis,Culiseta inornata,Culiseta melanura,人肤蝇(Dermatobia homini s),厕蝇属(Fannia spp.)如夏厕蝇(Fannia canicularis),肠胃蝇(Gasterophilus intestinalis),刺舌蝇(Glossina morsitans),须舌蝇(Glossina palpalis),棕足舌蝇(Glossina fuscipes),拟寄舌蝇(Glossina tachinoides),西方角蝇(Haematobia irritans),鞍瘿蚊(Haplodiplosis equestris),Hippelates spp.,皮蝇属(Hypoderma spp.)如Hypoderma lineata,Leptoconops torrens,Lucilia caprina,绿蝇属(Lucilia spp.)如铜绿蝇(Lucilia cuprina),丝光绿蝇(Lucilia sericata),Lycoria pectoralis,曼蚊属(Mansonia spp.),家蝇属(Musca spp.)如家蝇(Musca domestica),厩腐蝇(Muscina stabulans),狂蝇属(Oestrus spp.)如羊狂蝇(Oestrus ovis),Phlebotomus argentipes,Psorophora columbiae,Psorophora discolor,Prosimulium mixtum,Sarcophaga haemorrhoidalis,麻蝇属(Sarcophaga sp.),Simulium vittatum,螯蝇属(Stomoxys spp.)如厩螯蝇(Stomoxys calcitrans),虻属(Tabanus spp.)如嗜牛虻(Tabanus bovinus),Tabanus atratus,Tabanus lineola,Tabanus similis,地中海实蝇(Ceratitis capi-tata),金蝇属(Chrysomyia spp.),黄蝇属(Cuterebra spp.),油橄榄果实蝇(Dacus oleae),果蝇属(Drosophila spp.),胃蝇属(Gastrophilus spp.),黑蝇属(Hylemyia spp.),虱蝇属(Hyppobosca spp.),斑潜蝇属(Liriomyza spp.),绿蝽属(Nezara spp.),瑞典麦秆蝇(Oscinella frit),菠菜泉蝇(Pegomyia hyoscyami),草种蝇属(Phorbia spp.),Tannia spp.,欧洲大蚊(Tipula paludosa),污蝇属(Wohlfahrtia spp.)；

[0404] 腹足纲(Gastropoda),例如,阿勇蛞蝓属(Arion spp.),双脐螺属(Biomphalaria

spp.),泡螺属(Bulinus spp.),蛞蝓属(Deroceras spp.),土蜗属(Galba spp.),椎实螺属(Lymnaea spp.),钉螺属(Oncomelania spp.),琥珀螺属(Succinea spp.);

[0405] 半翅目(Heteroptera),例如,南瓜缘蝽(Anasa tristis),拟丽蝽属(Antestiopsis spp.),土长蝽属(Blissus spp.),俊盲蝽属(Calocoris spp.),Campylomma livida,异背长蝽属(Cavelerius spp.),臭虫属(Cimex spp.),Creontiades dilutus,Dasynus piperis,Dichelops furcatus,胡椒网蝽(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(Leptocorisa spp.),棉铃喙缘蝽(Leptoglossus phyl-lopus),草盲蝽属(Lygus spp.),Macropes excavatus,盲蝽科(Miridae),绿蝽属(Nezara spp.),Oebalus spp.,Pentomidae,方背皮蝽(Piesma quadrata),壁蝽属(Piezodorus spp.),棉跳盲蝽(Psallus seriatus),Pseudacysta persea,红猎蝽属(Rhodnius spp.),可可褐盲蝽(Sahlbergella singularis),黑蝽属(Scotinophora)spp.,梨冠网蝽(Stephanitis nashi),Tibraca spp.,椎猎蝽属(Triatoma spp.);

[0406] 虱(虱目(Phthiraptera)),例如畜虱属(Damalinia spp.),血虱属(Haematopinus spp.),长颚虱属(Linognathus spp.),人虱属(Pediculus spp.),嚼虱属(Trichodectes spp.),头虱(Pediculus humanus capitis),Pediculus humanus corporis,Pthirus pubis,牛血虱(Haematopinus eurysternus),猪血虱(Haematopinus suis),牛颚虱(Linognathus vituli),Bovicola bovis,Menopon gallinae,雏鸡羽虱(Menacanthus stramineus)和牛管虱(Solenopotes ca-pillatus);

[0407] 蜱和寄生螨(寄螨目(Parasitiformes)):蜱(Ixodida),Ixodes scapularis,全环硬蜱(Ixodes holocyclus),Ixodes pacificus,血红扇头蜱(Rhiphicephalus sanguineus),安氏革蜱(Dermacentor andersoni),变异革蜱(Dermacentor variabilis),美洲花蜱(Amblyomma americanum),有斑花蜱(Ambryomma maculatum),Ornithodorus hermsi,Ornithodorus turicata和寄生螨(中气门亚目(Mesostigmata)),例如柏氏禽刺螨(Ornithonyssus bacoti)和鸡皮刺螨(Dermanyssus gallinae);

[0408] 辐螨亚目(Actinedida)(前气门亚目(Prostigmata))和粉螨目(Acaridida)(无气门亚目(Astigmata))例如蜂跗线螨属(Acarapis spp.),姬螯螨属(Cheyletiella spp.),禽螯厘螨属(Ornithocheyletia spp.),肉螨属(Myobia spp.),疮螨属(Psorergates spp.),蠕形螨属(Demodex spp.),恙螨属(Trombicula spp.),牦螨属(Listrophorus spp.),粉螨属(Acarus spp.),食酪螨属(Tyrophagus spp.),嗜木螨属(Caloglyphus spp.),颈下螨属(Hypodectes spp.),翅螨属(Pterolichus spp.),瘙螨属(Psoroptes spp.),痒螨属(Chorioptes spp.),耳螨属(Otodectesspp.),疥螨属(Sarcoptes spp.),痂螨属(Notoedres spp.),疙螨属(Knemidocoptes spp.),胞螨属(Cytodites spp.),和皮膜螨属(Laminosioptes spp);

[0409] 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),痒螨属(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.)，红斑蛛 (Latrodectus mactans)，Metatetranychus spp.，小爪螨属 (Oligonychus spp.)，钝缘蜱属 (Ornithodoros spp.)，全爪螨属 (Panonychus spp.)，柑橘皱叶刺瘿螨 (柑橘皱叶刺瘿螨 (Phyllocoptruta oleivora))，侧多食跗线螨 (Polyphagotarsonemus latus)，瘙螨属 (Psoroptes spp.)，扇头蜱属 (Rhipicephalus spp.)，根嗜螨属 (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.)，番茄斜背瘤瘿螨 (Vasates lycopersici)；

[0410] Bugs(异翅亚目 (Heteropterida))：温带臭虫 (Cimex lec-tularius)，热带臭虫 (Cimex hemipterus)，Reduvius senilis，椎猎蝽属 (Triatoma spp.)，红猎蝽属 (Rhodnius ssp.)，全圆蝽属 (Panstrongylus ssp.) 和齿背猎蝽 (Arilus critatus)；

[0411] 虱目 (Anoplurida)，例如血虱属 (Haematopinus spp.)，长颚虱属 (Linognathus spp.)，人虱属 (Pediculus spp.)，阴虱属 (Phtirus spp.)，和管虱属 (Solenopotes spp)；

[0412] 食毛目 (Mallophagida)(亚目 Arnblycerina 和 Ischnocerina)，例如毛羽虱属 (Trimenopon spp.)，Menopon spp.，巨羽虱属 (Trinoton spp.)，牛羽虱属 (Bovicola spp.)，Werneckiella spp.，Lepikentron spp.，嚼虱属 (Trichodectes spp.)，和猫羽虱属 (Felicola spp)；

[0413] 线虫 (roundworms) 线虫纲 (Nematoda)：

[0414] 鞭虫和 Trichinosis(Trichosyringida)，例如毛线虫科 (Trichinellidae)(毛线虫属 (Trichinella spp.)) 如旋毛形线虫 (Trichinella spiralis)，Trichinella nativa，Trichinella britovi，Trichinella nelsoni，Trichinella pseudopsiralis，(毛首科 (Trichuridae)) 鞭虫属 (Trichuris spp.) 如 Trichuris trichuria，毛细线虫属 (Capillaria spp)；

[0415] 小杆线虫目 (Rhabditida)，例如小杆线虫属 (Rhabditis spp)，类圆线虫属 (Strongyloides spp.)，Helicephalobus spp；

[0416] Strongylida，例如圆线虫属 (Strongylus spp.)，钩口线虫属 (Ancylostoma spp.)，Necator americanus，仰口线虫属 (Bunostomum spp.)(钩虫属)，毛圆线虫属 (Trichostrongylus spp.)，血矛线虫 (Haemonchus spp.) 如捻转血矛线虫 (Haemonchus contortus)，奥斯特线虫属 (Ostertagia spp.)，古柏线虫属 (Cooperia spp.)，细颈线虫属 (Nematodirus spp.)，网尾属 (Dictyocaulus spp.)，Cyathostoma spp.，结节线虫属 (Oesophagostomum spp.)，Stephanurus dentatus，Ollulanus spp.，夏伯特线虫属 (Chabertia spp.)，Stephanurus dentatus，Syngamus trachea，钩口线虫属 (Ancylostoma spp.)，钩虫属 (Uncinaria spp.)，球头属 (Globocephalus spp.)，板口线虫属 (Necator spp.)，后圆线虫属 (Metastrongylus spp.)，Muellerius capillaris，原圆属 (Protostrongylus spp.)，Angiostrongylus spp.，Parelaphostrongylus spp. Aleurostrongylus abstrusus，和 Dioctophyma renale；

[0417] 蠕虫纲，例如，十二指肠钩虫 (Ancylostoma duodenale)，Ancylostoma ceylanicum，Acylostoma braziliensis，丝状网尾线虫 (Dictyocaulus filaria)，心

形裂头绦虫(Diphyllobothrium latum)，细粒棘球绦虫(Echinococcus granulosus)，Echinococcus multilocularis，异刺属(Heterakis spp.)，微小膜壳绦虫(Hymenolepis nana)，Hyostrongulus spp.，罗阿线虫(Loa loa)，后睾吸虫属(Opisthorchis spp.)，盘尾丝虫(Onchocerca volvulus)，Schistosomen spp.，Strongyloides fuelleborni，粪类圆线虫(Strongyloides stercoralis)，Stronyloides spp.，牛带绦虫(Taenia saginata)，猪带绦虫(Taenia solium)，毛圆线虫属(Trichostrongylus spp.)；

[0418] 同翅目(Homoptera)，例如，无网长管蚜属(Acyrthosiphon spp.)，Aeneolamia spp.，Agonoscena spp.，粉虱属(Aleurodes spp.)，蔗裂粉虱(Aleurolobus barodensis)，粉虱属(Aleurothrixus spp.)，杧果叶蝉属(Amrasca spp.)，飞廉短尾蚜(Anuraphis cardui)，肾圆盾蚧属(Aonidiella spp.)，梨矮蚜(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.，土豆沟无网蚜(Aulacorthum solani)，粉虱属(Bemisia spp.)，李短尾蚜(Brachycaudus helichrysii)，Brachycolus spp.，甘蓝蚜(Brevicoryne brassicae)，小褐稻虱(Calligypona marginata)，Carneocephala fulgida，甘蔗粉角蚜(Ceratovacuna lanigera)，沫蝉科(Cercopidae)，蜡蚧属(Ceroplastes spp.)，草莓中瘤钉毛蚜(Chaetosiphon fragaefolii)，Chionaspis tegalensis，茶绿叶蝉(Chlorita onukii)，核桃黑斑蚜(Chromaphis juglandicola)，褐圆盾蚧属(Chrysomphalus ficus)，玉米叶蝉(Cicadulina mbila)，Coccomytilus halli，软蚧属(Coccus spp.)，茶蔗隐瘤蚜(Cryptomyzus ribis)，Dalbulus spp.，粉虱属(Dialeurodes spp.)，桔木虱属(Diaphorina spp.)，白背盾蚧属(Diaspis spp.)，Doralis spp.，履绵蚧属(Drosicha spp.)，西圆尾蚜属(Dysaphis spp.)，灰粉蚧属(Dysmicoccus spp.)，绿小叶蝉属(Empoasca spp.)，绵蚜属(Eriosoma spp.)，斑叶蝉属(Erythroneura spp.)，Euscelis bilobatus，咖啡地粉蚧(Geococcus coffeae)，假桃病毒叶蝉(Homalodisca coagulata)，桃大尾蚜(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)，球蚧属(Lecanium spp.)，蛎盾蚧属(Lepidosaphes spp.)，萝卜蚜(Lipaphi serysimi)，长管蚜属(Macrosiphum spp.)，Mahanarva fimbriolata，高粱蚜森林型(Melanaphis sacchari)，Metcalfiella spp.，麦无网蚜，黑缘平翅斑蚜(Monellia costalis)，Monelliopsis pecanis，瘤蚜属(Myzus spp.)，莴苣衲长管蚜，黑尾叶蝉属(Nephotettix spp.)，褐飞虱，Oncometopia spp.，Orthezia praelonga，杨梅缘粉虱(Parabemisia myricae)，薯个木虱属(Paratrioza spp.)，片盾蚧属(Parlatoria spp.)，瘿绵蚜属(Pemphigus spp.)，玉米花翅飞虱(Peregrinus maidis)，绵粉蚧属(Phenacoccus spp.)，杨平翅绵蚜(Phloeomyzus passerinii)，忽布疣蚜(Phorodon humuli)，倭蚜属(Phylloxera spp.)，百合并盾蚧(Pinnaspis aspidistrae)，臀纹粉蚧属(Planococcus spp.)，梨形原绵蚧(Protopulvinaria pyriformis)，桑白盾蚧(Pseudaulacaspis pentagona)，粉蚧属(Pseudococcus spp.)，木虱属(Psylla spp.)，金小蜂属(Pteromalus spp.)，Pyrilla spp.，笠圆盾蚧属(Quadraspidiotus spp.)，Quesada gigas，平刺粉蚧属(Rastrococcus spp.)，缢管蚜属(Rhopalosiphum spp.)，黑盔蚧属(Saissetia spp.)，Scaphoides titanus，麦二叉蚜(Schizaphis graminum)，苏铁刺圆盾蚧(Selenaspidus articulatus)，

长唇基飞虱属 (Sogata spp.)，白背飞虱 (Sogatella furcifera)，稻飞虱属 (Sogatodes spp.)，三角蝉 (Stictocephala festina)，Tenalaphara malayensis，美国核桃黑蚜 (Tinocallis caryaefoliae)，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.)，葡萄根瘤蚜 (Viteus vitifolii)；

[0419] 等翅目 (Isoptera)，例如，散白蚁属 (Reticulitermes spp.)，土白蚁属 (Odontotermes spp.)；

[0420] 鳞翅目 (Lepidoptera)，例如，桑剑纹夜蛾 (Acronicta major)，烦夜蛾 (Aedia leucomelas)，地夜蛾属 (Agrotis spp.)，Alabama argillacea，干煞夜蛾属 (Anticarsia spp.)，甘蓝夜蛾 (Barathra brassicae)，Bucculatrix thurberiella，松粉蝶尺蛾 (Bupalus piniarius)，黄尾卷叶蛾 (Cacoecia podana)，Capua reticulana，苹果小卷蛾 (Carpocapsa pomonella)，果园秋尺蛾 (Cheimatobia brumata)，禾草螟属 (Chilo spp.)，云杉色卷蛾 (Choristoneura fumiferana)，葡萄果蠹蛾 (Clysia ambiguella)，Cnaphalocerus spp.，埃及钻夜蛾 (Earias insulana)，地中海粉斑螟 (Ephestia kuehniella)，黄毒蛾 (Euproctis chrysorrhoea)，切夜蛾属 (Euxoa spp.)，Feltia spp.，蜡螟 (Galleria mellonella)，Helicoverpa spp.，实夜蛾属 (Heliothis spp.)，褐织蛾 (Hofmannophila pseudospretella)，茶长卷蛾 (Homona magnanima)，苹果巢蛾 (Hyponomeuta padella)，贪夜蛾属 (Laphygma spp.)，Lithocolletis blancardella，绿果冬夜蛾 (Lithophane antennata)，Loxagrotis albicosta，毒蛾属 (Lymantria spp.)，黄褐天幕毛虫 (Malacosoma neustria)，甘蓝夜蛾 (Mamestra brassicae)，Mocisrepanda，Mythimna separata，Oria spp.，水稻负泥虫 (Oulema oryzae)，小眼夜蛾 (Panolis flammea)，棉红铃虫 (Pectinophora gossypiella)，柑橘叶潜蛾 (Phyllocnistis citrella)，粉蝶属 (Pieris spp.)，小菜蛾 (Plutella xylostella)，斜纹夜蛾属 (Prodenia spp.)，伪碾夜蛾属 (Pseudaletia spp.)，大豆尺夜蛾 (Pseudoplusia includens)，玉米螟 (Pyrausta nubilalis)，贪夜蛾属 (Spodoptera spp.)，Thermesia gemmatalis，袋谷蛾 (Tinea pellionella)，幕谷蛾 (Tineola bisselliella)，栎绿卷蛾 (Tortrix viridana)，粉夜蛾属 (Trichoplusia spp.)；

[0421] 直翅目 (Orthoptera)，例如，居屋艾蟋 (Acheta domesticus)，东方蜚蠊 (Blatta orientalis)，德国小蠊 (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)；

[0422] 缨翅目 (Thysanoptera)，例如，稻蓟马 (Baliothrips biformis)，Enneothrips flavens，花蓟马属 (Frankliniella spp.)，实夜蛾属 (Heliothrips spp.)，温室条蓟马 (Hercinothrips femoralis)，卡蓟马属 (Kakothrips spp.)，葡萄蓟马 (Rhipiphorothrips cruentatus)，硬蓟马属 (Scirtothrips spp.)，Taeniothrips cardamoni，蓟马属 (Thrips spp.)；

[0423] 原生动物纲 (Protozoa) 例如，艾美球虫属 (Eimeria spp.)；

[0424] 肠线虫 (蛔虫目 (Ascaridida))，例如蛔虫属 (Ascaris spp.) 如人蛔虫 (Ascaris lumbricoides)，Ascaris suum，Ascaridia galli，Parascaris equorum，蛲虫 (Enterobius

vermicularis)(蛲虫),Toxocara canis,Toxascaris leonine,斯氏虫属(Skrjabinema spp.),和 Oxyuris equi;

[0425] 驼形目(Camallanida),例如 Dracunculus medinensis(麦地那龙线虫)

[0426] 旋尾目(Spirurida),例如吸吮线虫属(Thelazia spp.)吴策属(Wuchereria spp.)如班氏吴策线虫(Wuchereria bancrofti),布鲁属(Brugia spp.)如马来布鲁线虫(Brugia malayi),Brugia timori,,盘尾属(Onchocerca spp.),Dirofilari spp.,双瓣丝虫属(Dipetalonema spp.),狗尾草属(Setaria spp.),丝绒虫属(Elaeophora spp.),Spirocerca lupi,和胃线虫属(Habronema spp.);

[0427] 具刺头蠕虫(棘头纲(Acanthocephala)),例如棘头虫属(Acanthocephalus spp.),Macracanthorhynchus hirudinaceus 和结居棘头虫属(Oncicola spp);

[0428] 真涡虫(扁蠕虫类(Plathelminthes));

[0429] 吸虫(吸虫纲(Trematoda)),例如 Faciola spp.,Fascioloides magna,并殖吸虫属(Paragonimus spp.),双腔吸虫属(Dicrocoelium spp.),Fasciolopsis buski,支睾吸虫属(Clonorchis spp.)如 Clonorchis sinensis;血吸虫属(Schistosoma spp.),Trichobilharzia spp.,Alaria alata,并殖吸虫属(Paragonimus spp.),和 Nanocyetes spp;

[0430] Cercomeromorpha,特别是真绦虫亚纲(Cestoda)(绦虫),例如裂头属(Diphyllobothrium spp.),Tenia spp.,棘球属(Echinococcus spp.),Dipylidium caninum,多头绦虫属(Multiceps spp.),膜壳属(Hymenolepis spp.),中殖孔属(Mesocestoides spp.),Vampirolepis spp.,蒙尼属(Moniezia spp.),裸头绦虫属(Anoplocephala spp.),Sirometra spp.,裸头绦虫属(Anoplocephala spp.),和膜壳属(Hymenolepis spp)。

[0431] 式 I 化合物和含有它们的组合物特别有用地防除双翅目(Diptera),蚤目(Siphonaptera)和 Ixodida 害虫。

[0432] 此外,式 I 化合物和含有它们的组合物用于对抗蚊的用途是特别优选的。

[0433] 式 I 化合物和含有它们的组合物对抗蝇的用途是本发明的又一优选的实施方式。

[0434] 此外,式 I 化合物和含有它们的组合物对抗蚤目的用途是特别优选的。

[0435] 式 I 化合物和含有它们的组合物对抗蜱的用途是本发明的又一优选实施方式。

[0436] 式 I 化合物也特别有用地对抗内寄生虫(包括但不限于,线虫、绦虫、吸虫和原生动物)。

[0437] 式 I 化合物能够通过接触(经由土壤、玻璃、壁、床帐、地毯、毡毯或动物部分)和摄食(例如饵料)起效。

[0438] 本发明涉及式 I 化合物防除和/或对抗动物体内和/或体表寄生虫的治疗和非治疗用途。

[0439] 可以通过与杀寄生有效量的式 I 化合物接触,将式 I 化合物用来保护动物免于寄生虫攻击或侵染。就此,“接触”包括直接接触(将所述化合物/组合物直接施用在寄生物上,例如也其所在地,和任选地也将所述化合物/组合物直接给予在动物上)和间接接触(将所述化合物/组合物施用至寄生物所在地)。通过施用至其所在地来接触寄生物是式 I 化合物非治疗性用途的实例。

[0440] “所在地”如上定义意指动物以外其中寄生物正在生长或可以生长的生境、食品供给、繁殖场、区域、材料或环境。本发明的化合物还可以预防性地施用至预期存在害虫或寄生虫的场所。

[0441] 向动物的施用能够预防地和处理地进行。活性化合物的施用直接进行或以适宜制剂形式经口、局部 / 皮肤或肠胃外地进行。

[0442] 为了口服施用至温血动物，式 I 化合物可以配制为动物饲料、动物饲料预混物，动物饲料浓缩物，丸剂，溶液，糊剂，悬浮液，灌服药，凝胶，片剂包括可咀嚼片剂，药丸和胶囊。另外，式 I 化合物可以在饮用水中给予至动物。为了口服施用，选择的剂型应当向动物提供 0.01mg/kg 至 100mg/kg 动物体重每天的式 I 化合物，优选地 0.5mg/kg 至 100mg/kg 动物体重每天的式 I 化合物。

[0443] 备选地，式 I 化合物可以肠胃外地给予动物，例如通过瘤胃内、肌内、静脉内或皮下注射。式 I 化合物可以分散于或溶于生理学可接受的载体中，用于皮下注射。备选地，式 I 化合物可以配制成用于皮下施用的植入物。此外，式 I 化合物可以透皮给予至动物。为了肠胃外施用，选择的剂型应当向动物提供 0.01mg/kg 至 100mg/kg 动物体重每天的式 I 化合物。

[0444] 式 I 化合物还可以以滴剂，粉剂，粉末，项圈，圆形装饰，喷雾剂，香波，涂抹剂，喷雾和泼浇剂配制剂以及软膏或水包油或油包水乳液的形式局部施用至动物。为了局部施用，滴剂和喷雾剂通常包含 0.5ppm 至 5,000ppm 和优选 1ppm 至 3,000ppm 的式 I 化合物。另外，式 I 化合物可以配制为动物，特别是四足动物如牛和绵羊的耳标。

[0445] 泼浇剂配制剂描述于美国专利号 6,010,710，在此通过引用将其并入本文。泼浇剂配制剂可以有利地是油性的，并一般包含稀释剂或媒介物，如果后者不可溶于稀释剂则还包含活性成分的溶剂（例如有机溶剂）。

[0446] 涂抹剂配制剂描述于美国专利号 6,395,765 ;6,867,2296,096,329 ;6,426,333，和 6,685,954，在此通过引用将其公开内容全部并入本文。

[0447] 适宜的制剂包括而不限于 :

[0448] - 溶液如口服溶液，稀释之后口服给予的浓缩物，用于皮肤上或体腔内的溶液，浇灌配制剂，凝胶 ;

[0449] - 用于口服或皮肤施用的乳液和悬浮液 ;半固体制剂 ;

[0450] - 配制剂，其中活性化合物处理为软膏基质或为水包油或油包水乳液基质 ;

[0451] - 固体制剂如粉末，预混物或浓缩物，颗粒剂，丸粒剂，片剂，药丸，胶囊 ;气雾剂和吸入剂，和含有活性化合物的成型物品。

[0452] 适于注射的组合物通过将活性成分溶于适宜的溶剂或载体中，并任选加入其它成分如酸、碱、缓冲剂盐、保藏剂和增溶剂来制备。可将溶液过滤并无菌填充。适宜的溶剂是生理学可忍耐的溶剂，如水和有机溶剂包括烷醇如乙醇、丁醇、异丙醇、苯甲醇、甘油、丙二醇、聚乙二醇、N- 甲基 - 吡咯烷酮、2- 吡咯烷酮及其混合物。其它适宜的溶剂包括但不限于，乙酰基三丁基柠檬酸酯，脂肪酸酯类如脂肪酸二甲酯，二异丁基己二酸酯，丙酮，乙腈，丁基二甘醇，二甲基乙酰胺，二甲基甲酰胺，二丙二醇 n- 丁醚，1,2- 乙二醇单乙醚，1,2- 乙二醇单甲醚，单甲基乙酰胺，二丙二醇单甲醚，液体聚氧基 1,2- 乙二醇，二甘醇单乙醚，1,2- 乙二醇和二乙基邻苯二甲酸酯，或这些溶剂中至少二种的混合物。

[0453] 活性化合物能够任选地溶于生理学可忍耐的适于注射的植物油或合成油。

[0454] 作为媒介物或稀释剂可以提及植物油，例如但不限于大豆油，花生油，蓖麻油，玉米油，棉花油，橄榄油，油菜籽油，葵花油，椰子油等；矿物油，例如但不限于，凡士林，石蜡，硅酮等；脂族或环状烃，或备选地例如中链（如 C_8-C_{12}）甘油三酯。

[0455] 适宜的增溶剂是促进活性化合物溶于主要溶剂或预防其沉淀的溶剂。实例是聚乙烯吡咯烷酮，聚乙烯醇，聚氧乙烯烷基酚蓖麻油，和聚氧乙烯烷基酚脱水山梨醇酯。适宜的保藏剂是苯甲醇，三氯丁醇，p- 羟基苯甲酸酯类，和 n- 丁醇。

[0456] 在局部组合物的某些实施方式中，所述组合物能够呈即用溶液形式，如例如美国专利号 6,395,765 的描述，通过引用将其并入本文。在活性试剂化合物之外，即用溶液可包含结晶抑制剂、有机溶剂和有机共溶剂。

[0457] 在某些实施方式中，结晶抑制剂能够以约 1 至约 30％ (w/v) 的比例存在。典型地，结晶抑制剂可以以约 1％至约 20％ (w/v) 或约 5％至约 15％ (w/v) 的比例存在。可接受的抑制剂是在施用配制剂时加入配制剂来抑制晶体形成的那些。在某些实施方式中，配制剂可以包括不同于本文所列那些的充当结晶抑制剂的化合物。在这些实施方式中，结晶抑制剂的适用性可以由试验其是否充分抑制晶体形成的测试来确定：在 20℃置于玻璃载玻片上经过 24 小时的情况下，在如上所述的溶剂中含有 10％ (w/v) 式 I 化合物的样品在具有 10％ (w/v) 结晶抑制剂的情况下导致小于 20 粒，优选少于 10 粒晶体。

[0458] 用于本发明的结晶抑制剂包括但不限于：

[0459] (a) 聚乙烯吡咯烷酮，聚乙烯醇类，乙酸乙烯酯的共聚物和乙烯基吡咯烷酮的共聚物，2- 吡咯烷酮包括 N- 甲基吡咯烷酮，二甲亚砜，聚乙二醇，苯甲醇，甘露醇，甘油，山梨醇或脱水山梨醇的聚氧乙烯化酯类；卵磷脂或羧甲纤维素钠；或丙烯酸衍生物，如甲基丙烯酸酯和衍生自丙烯酸单体的聚合物，如本文描述的抑制活性试剂结晶的溶剂，等等；

[0460] (b) 阴离子型表面活性剂，如碱性硬脂酸盐（例如硬脂酸钠、钾或铵盐）；硬脂酸钙或三乙醇胺硬脂酸盐；松香酸钠；烷基硫酸盐，其包括但不限于月桂基硫酸钠和鲸蜡基硫酸钠；十二烷基苯磺酸钠或二辛基磺基琥珀酸钠；或脂肪酸（例如椰子油）；

[0461] (c) 阳离子型表面活性剂，如水溶性的式 $N^+R'\ R''\ R'''\ R''''\ Y^-$ 季铵盐，其中 R 残基等同或不同的任选羟化的烃残基而 Y^- 是强酸的阴离子，如卤阴离子，硫酸根和磺酸根阴离子；鲸蜡基三甲基溴化铵是可使用的阳离子型表面活性剂之一；

[0462] (d) 式 $NR'\ R''\ R'''$ 胺盐，其中 R 残基是等同或不同的任选羟化的烃残基；十八烷胺盐酸化物是可以使用的阳离子型表面活性剂之一；

[0463] (e) 非离子型表面活性剂，如脱水山梨醇的任选地聚氧乙烯化的酯类，例如聚山梨酯 80，或聚氧乙烯化的烷基醚类；聚乙二醇硬脂酸盐，蓖麻油的聚氧乙烯化的衍生物，聚甘醇酯类，聚氧乙烯化的脂肪醇，聚氧乙烯化的脂肪酸或环氧乙烷的共聚物和环氧丙烷的共聚物；

[0464] (f) 两性表面活性剂，如经取代的月桂基甜菜碱化合物；或者

[0465] (g) 列于上述 (a)-(f) 所述化合物中至少二种的混合物。

[0466] 口服溶液直接给予。浓缩物在事先稀释至使用浓度之后口服给予。口服溶液和浓缩物根据现有技术和如上对注射液所述来制备，无菌程序不是必需的。

[0467] 在本发明的一种实施方式中，所述组合物可以是糊剂形式。糊剂形式实施方式的

实例包括但不限于描述于美国专利号 6,787,342 和 7,001,889 的那些（各自通过引用并入本文）。

[0468] 用于皮肤上的溶液可以淌滴、涂覆、揉搓、喷洒或喷雾。

[0469] 用于皮肤上的溶液根据现有技术和根据上文对注射液的描述制备，无菌程序不是必需的。

[0470] 其它适宜的溶剂包括聚丙二醇，苯基乙醇，苯氧基乙醇，酯如乙酸乙基酯或乙酸丁基酯，苯甲酸苄酯，醚类如烷二醇烷基醚，例如二丙二醇单甲基醚，酮类如丙酮，甲基乙基酮，芳族烃，蔬菜和合成油，二甲基甲酰胺，二甲基乙酰胺，transcutol，solketal，碳酸亚丙酯，及其混合物。

[0471] 可以有利地在制备期间加入增稠剂。适宜的增稠剂包括无机的增稠剂如斑脱土，胶体硅酸，单硬脂酸铝，有机增稠剂如纤维素衍生物，聚乙烯醇类及其共聚物，丙烯酸酯和甲基丙烯酸酯。

[0472] 凝胶被施用至或铺展于皮肤上或引入体腔内。凝胶这样制备：将已经如上文对注射液的描述制备的溶液用足够的增稠剂处理，得到类软膏质地的透明材料。采用的增稠剂包括上述增稠剂。

[0473] 泼浇剂配制剂被倾倒至或喷雾至皮肤的限制区域，从而活性化合物穿透皮肤并起全身作用。

[0474] 泼浇剂配制剂可以通过使得活性化合物溶解、抗沉降或乳化于适宜皮肤相容性溶剂或溶剂混合物而制备。如果适当，加入其它助剂如着色剂，生物吸收促进物质，抗氧化剂，光稳定剂，粘合剂。

[0475] 适宜的溶剂，其包括水，烷醇，二醇类，聚乙二醇，聚丙二醇，甘油，芳族醇类如苯甲醇，苯基乙醇，苯氧乙醇，酯类如乙酸乙酯，乙酸丁基酯，苯甲酸苄酯，醚类如亚烷基二醇烷基醚类如二丙二醇单甲醚，二甘醇单丁醚，酮类如丙酮，甲基乙基酮，环状碳酸盐如碳酸亚丙酯，碳酸亚乙酯，芳族和 / 或脂族烃，植物或合成油，DMF，二甲基乙酰胺，n- 烷基吡咯烷酮如甲基吡咯烷酮，正丁基吡咯烷酮或正辛基吡咯烷酮，N- 甲基吡咯烷酮，2- 吡咯烷酮，2，2- 二甲基 -4- 氧基 - 亚甲基 -1，3- 二氧杂环戊烷和环亚甲基甘油醚。

[0476] 适宜的着色剂包括允许用于动物且能够溶解或悬浮的全部着色剂。

[0477] 适宜的吸收促进物质包括，例如 DMSO，展膜油剂如肉豆蔻酸异丙基酯，二丙二醇壬酸酯，硅油及其与聚醚的共聚物，脂肪酸酯类，甘油三酯，脂肪醇。

[0478] 适宜的抗氧化剂包括亚硫酸盐或焦亚硫酸氢盐如焦亚硫酸氢钾，抗坏血酸，丁基羟基甲苯，丁基羟基茴香醚，和生育酚。

[0479] 适宜的光稳定剂包括，例如，novantisolic acid。

[0480] 适宜的粘合剂包括，例如，纤维素衍生物，淀粉衍生物，聚丙烯酸类，天然聚合物如藻酸盐，明胶。

[0481] 乳液能够口服、皮肤或注射地给予。乳液是油包水类型或水包油类型。它们可以这样制备：将活性化合物溶于疏水相或亲水相，并借助适宜的乳化剂将其与其它相的溶剂匀化，如果适当与其它助剂如着色剂、吸收促进物质、保藏剂、抗氧化剂、光稳定剂、增粘物一起匀化。

[0482] 适宜的疏水相包括液状石蜡，硅油，天然植物油如芝麻油、杏仁油、蓖麻油、合成甘

油三酯如二甘油辛 / 癸酯，与链长 C_8-C_{12}植物脂肪酸或其它专门选择天然脂肪酸的甘油三酯混合物，可能也含有羟基基团的饱和或不饱和脂肪酸的偏甘油酯混合物，C_8-C_{10}脂肪酸的单甘油酯和二甘油酯，脂肪酸酯类如硬脂酸乙基酯，二 -n- 丁酰基己二酸酯，月桂酸己基酯，壬酸二丙二醇酯，中等链长支化的脂肪酸与链长 C_{16}-C_{18}饱和脂肪醇的酯，肉豆蔻酸异丙酯，棕榈酸异丙基酯，链长 C_{12}-C_{18}饱和脂肪醇的辛 / 癸酸酯类，硬脂酸异丙基酯，油酸油烯基酯，油酸癸基酯，油酸乙酯，乳酸乙基酯，蜡质脂肪酸酯类如合成的鸭尾脂腺脂肪，邻苯二甲酸二丁基酯，己二酸二异丙基酯，和与后者相关的酯混合物，脂肪醇如己三癸基醇，2- 辛基十二烷醇，鲸蜡基硬脂醇，油醇，和脂肪酸如油酸及其混合物。

[0483] 适宜的亲水相为 :水，醇类如丙二醇，甘油，山梨醇及其混合物。

[0484] 适宜的乳化剂包括非离子型表面活性剂，例如聚乙氧基化蓖麻油，聚乙氧基化脱水山梨醇单油酸酯，脱水山梨醇单硬脂酸酯，单硬脂酸甘油酯，聚氧基乙基硬脂酸酯，烷基苯酚聚乙二醇醚 ;两性表面活性剂如 N- 月桂基 -p- 亚氨基二丙酸二钠盐或卵磷脂 ;阴离子型表面活性剂，如月桂基硫酸钠，脂肪醇醚硫酸盐，一 / 二烷基聚乙二醇醚磷酸酯单乙醇胺盐 ;和阳离子活性表面活性剂，如氯化鲸蜡基三甲基铵。

[0485] 适宜的其它助剂为 :增强乳液粘度和稳定化乳液的物质，如羧甲纤维素，甲基纤维素和其它纤维素和淀粉衍生物，聚丙烯酸类，藻酸盐，明胶，阿拉伯树胶，聚乙烯吡咯烷酮，聚乙烯醇，甲基乙烯醚和马来酸酐的共聚物，聚乙二醇，蜡，胶体硅酸或上述物质的混合物。

[0486] 悬浮液能够口服给予或局部地 / 皮肤地给予。它们可以这样制备 :在助悬剂中悬浮活性化合物，如果适当则加入其它助剂如润湿剂、着色剂、生物吸收促进物质、保藏剂、抗氧化剂、光稳定剂。

[0487] 液体助悬剂包括全部均质溶剂和溶剂混合物。

[0488] 适宜的润湿剂（分散剂）包括上述的乳化剂。

[0489] 可以提及的其它助剂包括上述的那些。

[0490] 半固体制剂能够口服给予或局部地 / 皮肤地给予。它们不同于上述悬浮液和乳液之处仅是它们的较高粘度。

[0491] 为了制备固体制剂，将活性化合物与适宜的赋形剂混合，如果适当则加入助剂，并使之形成所希望的形式。

[0492] 适宜的赋形剂包括全部生理学可忍耐的固体惰性物质。所用的那些是无机物和有机物。无机物是例如氯化钠，碳酸盐如碳酸钙，碳酸氢盐，氧化铝，氧化钛，硅酸，粘质土，沉积硅或胶体硅，或磷酸盐。有机物质是例如，糖，纤维素，食物和饲料如奶粉，动物粉，谷粉和谷屑，淀粉。

[0493] 适宜的助剂包括上文已经提及的保藏剂，抗氧化剂，和 / 或着色剂。

[0494] 其它适宜的助剂包括润滑剂和助流剂如硬脂酸镁，硬脂酸，滑石粉，斑脱土，崩解促进性物质如淀粉或交联的聚乙烯吡咯烷酮，粘合剂如淀粉，明胶或线性聚乙烯吡咯烷酮，和无水粘合剂如微晶纤维素。

[0495] 一般而言，“杀寄生虫有效量”意指对生长实现可观察效果所需要的活性成分的量，包括坏死，死亡，阻滞，预防，和除去，破坏，或者减少靶标生物体存在和其活性的效果。对于本发明所用各种化合物 / 组合物，杀寄生虫有效量能够变化。杀寄生虫有效量的所述组合物也根据主要条件如希望的杀寄生虫效果和持续时间、靶标种类、施用模式等而变化。

[0496] 可用于本发明的组合物包含能够一般约 0.001 至 95％的式 I 化合物。

[0497] 在某些实施方式中，有利地以 0.5mg/kg 至 100mg/kg 每天，优选 1mg/kg 至 50mg/kg 每天的总量施用式 I 化合物。

[0498] 含有所述化合物的即用制剂以 10ppm 至 80％重量，优选 0.1 至 65％重量，更优选 1 至 50％重量，最优选 5 至 40％重量的浓度对寄生虫优选外寄生虫起作用。

[0499] 在使用之前稀释的制剂典型地含有对抗外寄生虫的化合物，其浓度为 0.5 至 90％重量，优选 1 至 50％重量。

[0500] 此外，制剂典型地包含对抗内寄生虫的式 I 化合物，其浓度为 10ppm 至 2％重量，优选 0.05 至 0.9％重量，很特别地优选 0.005 至 0.25％重量。

[0501] 制剂中杀内外寄生物剂的有效量可以选自约 0.1mg/kg 至约 200mg/kg 动物重量或约 1 至约 200mg/kg 动物重量的范围。

[0502] 包含本发明化合物的兽医组合物可以任选地还包含至少一种其它相关的杀寄生虫成分，如杀昆虫剂、杀螨剂、杀寄生物剂等。

[0503] 其它杀寄生物剂可以是大环内酯类型的杀内外寄生物剂。该大环内酯类型杀寄生物剂包括但不限于阿维菌素类 (avermectins) 及其衍生物，其包括但不限于阿维菌素 (abamectin)，地马待克丁 (dimadectin)，多拉克汀 (doramectin)，埃玛菌素 (emamectin)，依立诺克丁 (eprinomectin)，伊维菌素 (ivermectin)，拉替待克丁 (latidectin)，lepimectin，司拉克丁 (selamectin)，和米尔倍霉素 (milbemycin) 及其衍生物包括但不限于弥拜菌素 (milbemectin)，莫昔克汀 (moxidectin)，奈马克汀 (nemadectin) 和米尔倍霉素 (milbemycin)D。

[0504] 阿维菌素 (avermectin) 和米尔倍霉素 (milbemycin) 系列的化合物是对抗宽范围的内寄生虫和外寄生虫的有效的驱虫剂和抗寄生虫药剂。属于该系列的化合物是天然产品或其半合成的衍生物。这些两个化合物系列的结构密切相关，它们均包括复杂的 16- 元大环内酯环；然而，米尔倍霉素 (milbemycin) 不含内酯环 13- 位的苷配基取代基。天然产品阿维菌素类 (avermectins) 揭示于 Albers-Schonberg 等人的美国专利 4,310,519，而 22,23- 二氢阿维菌素 (avermectin) 化合物揭示于 Chabala 等人的美国专利 4,199,569。对于阿维菌素类 (avermectins) 的一般讨论 (包括它们在人类和动物中的用途的讨论) 参见“Ivermectin and Abamectin，”W.C.Campbell，ed.，Springer-Verlag，New York(1989)。天然米尔倍霉素类 (milbemycins) 描述于 Aoki 等人的美国专利 3,950,360 以及“The Merck Index”12th ed.，S.Budavari，Ed.，Merck & Co.，Inc.Whitehouse Station，New Jersey(1996) 中引用的各种参考文献。这些化合物类的半合成衍生物是本领域中所熟知的，并且例如描述于美国专利 5,077,308，美国专利 4,859,657，美国专利 4,963,582，美国专利 4,855,317，美国专利 4,871,719，美国专利 4,874,749，美国专利 4,427,663，美国专利 4,310,519，美国专利 4,199,569，美国专利 5,055,596，美国专利 4,973,711，美国专利 4,978,677，和美国专利 4,920,148，通过引用将它们全部内容都并入本文。特别优选的化合物包括伊维菌素 (ivermectin)，埃玛菌素 (emamectin)，阿维菌素 (abamectin)，多拉克汀 (doramectin)，埃玛菌素 (emamectin)，依立诺克丁 (eprinomectin)，莫昔克汀 (moxidectin) 和司拉克丁 (selamectin)。

[0505] 可以包括于本发明配制剂或方法中的其它化合物类是昆虫生长调节剂 (IGR)。属

于该组的化合物是从业者熟知的，并且代表宽范围的不同的化学类。这些化合物全部通过干扰昆虫害虫的发育或生长来起效。对各种外寄生虫的未成熟阶段具有杀卵和 / 或杀幼虫效果的化合物已知自例如美国专利号 5,439,924。在所描述的这些化合物中尤其提及通过阻断未成熟阶段（卵和幼虫）发育为成虫阶段，或者通过抑制壳多糖合成起效的那些 I GR 化合物。昆虫生长调节剂例如描述于美国专利 3,748,356 ；美国专利 3,818,047 ；美国专利 4,225,598 ；美国专利 4,798,837 ；和美国专利 4,751,225，以及 EP 179,022 或 U.K.2,140,010 中，通过引用将其全部公开内容都并入本文。通过援引并入本文的法国专利号 A-2,713,889 一般地描述了 IGR 组合，该组合包含至少一种具保幼激素活性的化合物和壳多糖合成抑制剂，以及三种 N- 芳基二唑化合物中的至少一种特别是氟虫腈 (fipronil)，用于防除属于各种类别的许多有害昆虫。

[0506] 本发明兽医配制剂中可以使用的 IGR 的实例包括模拟保幼激素的化合物，特别是 ：印苦楝子素 -Agridyne，苯虫醚 (diofenolan)，苯氧威 (fenoxycarb)，烯虫乙酯 (hydroprene)，烯虫炔酯 (kinoprene)，烯虫酯 (methoprene)，吡丙醚 (pyriproxyfen)，四氢印苦楝子素，4- 氯 -2-(2- 氯 -2- 甲基丙基)-5-(6- 碘 -3- 吡啶基甲氧基) 吡啶 -3(2H)- 酮，和壳多糖 - 合成抑制剂，特别是 ：氟啶脲 (chlorfluazuron)，环丙马秦 (cyromazine)，除虫脲 (diflubenzuron)，啶蜱脲 (fluazuron)，氟环脲 (flucycloxuron)，氟虫脲 (flufenoxuron)，氟铃脲 (hexaflumuron)，氯芬奴隆 (lufenuron)，虫酰肼 (tebufenozide)，氟苯脲 (teflubenzuron)，杀铃脲 (triflumuron) 这些化合物由它们的国际通用名定义 (The Pesticide Manual,10th edition,1994, Ed.Clive Tomlin, Great Britain)。壳多糖 - 合成抑制剂也包括化合物如 1-(2,6- 二氟苯甲酰基)-3-(2- 氟 -4-((三氟甲基) 苯基脲，1-(2,6- 二氟苯甲酰基)-3-(2- 氟 -4-(1,1,2,2- 四氟乙氧基) 苯基脲和 1-(2,6- 二氟苯甲酰基)-3-(2- 氟 -4- 三氟甲基) 苯基脲。氟酰脲 (novaluron) 也是 IGR 的实例。特别优选的 IGR 包括烯虫酯 (methoprenes)，吡丙醚 (pyriproxyfens)，烯虫乙酯 (hydroprene)，环丙马秦 (cyromazine)，氯芬奴隆 (lufenuron)，1-(2,6- 二氟苯甲酰基)-3-(2- 氟 -4-(三氟甲基) 苯基脲和氟酰脲 (novaluron)。

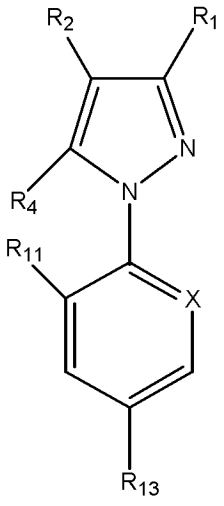
[0507] 作为另一类别化合物一部分的其它杀寄生物剂是杀外寄生物剂。优选地，杀外寄生物剂是芳基吡唑。适宜的芳基吡唑的实例是描述于 EP 295117(美国专利 5232940, 5547974,5608077,5714191,5916618 和 6372774) 的那些，在此将其全部通过引用整体并入本文。其它 N- 芳基吡唑化合物描述于 US 专利号 4,963,575 ；5,885,607 ；6,083,519 ；6,010,710 ；6,096,329(6,685,954) ；EP 0234119，和 EP 0352944 ；US 专利号 5,817,688 ；5,922,885 ；5,994,386 ；6,124,339 ；6,180,798 和 6,395,906 和 EP 0780378 ；US 专利号 6,069,157 和 EP 0846686 ；US 专利号 6,350,771 和 EP 0948485，在此将其全部通过引用整体并入本文。已知 N- 芳基 - 吡唑类具有优异的抗昆虫如蚤目和蜱的活性。氟虫腈 (fipronil) 是特定类型的 N- 芳基 - 吡唑，其特别地有效对抗蚤目和蜱，并且是 Frontline® 和 Frontline Plus ® 中的活性成分。

[0508] 例如，在芳基吡唑分子中，芳基基团连接至吡唑 1- 位的吡唑基团，且芳基基团是经取代的苯基基团。优选地，在经取代的苯基基团中，取代位于苯基环的 2 位、4 位和 / 或 6 位，且所述取代基选自下组 ：C_1-C_4 烷基，卤素，和 C_1-C_4- 卤烷基。更优选，吡唑任选在 3- 位由选自下组的部分取代 ：氰基，硝基，卤素，乙酰基或甲酰基 ；任选在 4- 位由 Z-S(O)$_q$- 取代，其

中 Z 是 C_1-C_4烷基或 C_1-C_4- 卤烷基和 q 是 0、1 或 2；并且任选在 5- 位由氨基基团或经 C_1-C_4烷基或 C_1-C_4烷酰基基团取代的氨基取代。最优选地，芳基吡唑化合物是 5- 氨基 -1-[2，6- 二氯 -4-（三氟甲基）苯基]-4-[（三氟甲基）亚硫酰基]-1H- 吡唑 -3- 腈（“氟虫腈 (fipronil)”），pyriprole 和 pyrafluprole。

[0509] 在一种实施方式中，本发明式 I 化合物可以与如下所示的式 2 化合物组合给予：

[0510]



(2)

[0511] 其中：

[0512] R_1是烷基，CN 或卤素；

[0513] R_2是 $S(O)_nR_3$或 4,5- 二氰基咪唑 -2- 基或卤烷基；

[0514] R_3是烷基或卤烷基；

[0515] R_4是氢，卤素，$-NR_5R_6$，$-S(O)_mR_7$，$-C(O)R_7$，$-C(O)OR_7$，烷基，卤烷基，$-OR_8$或 -N ＝ $C(R_9)(R_{10})$；

[0516] R_5和 R_6独立地代表氢，烷基，卤烷基，-C(O) 烷基，$-S(O)_rCF_3$或烷氧羰基；或

[0517] R_5和 R_6能够一起形成二价亚烷基残基，其任选被一或二个二价杂原子打断；

[0518] R_7是烷基或卤烷基；

[0519] R_8为氢，烷基或卤烷基；

[0520] R_9为氢或烷基残基；

[0521] R_{10}是任选取代的芳基或任选取代的杂芳基基团；

[0522] R_{11}和 R_{12}相互独立地代表氢，卤素 CN 或 NO_2；

[0523] R_{13}是卤素，卤烷基，卤烷氧基，$S(O)_qCF_3$或 SF_5基团；

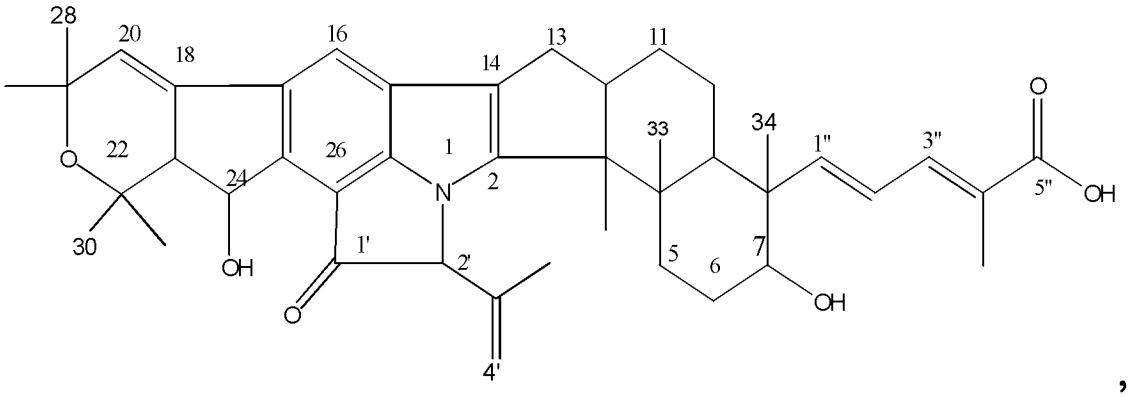
[0524] m，n，q 和 r 相互独立地代表等于 0、1 或 2 的整数；和

[0525] X 表示三价氮原子或 C-R_{12}残基，所述碳原子的三个其它价键形成芳环的一部分。

[0526] 还预期的是，例如，结袍酸 (nodulisporic acid) 或结袍酸衍生物。结袍酸和结袍酸衍生物是在本领域中已知为有效抗内寄生物剂和抗外寄生物剂的一类化合物。这些化合物基于三种结构 A、B 或 C，它们具有以下结构：

[0527] 结袍酸（化合物 A）：

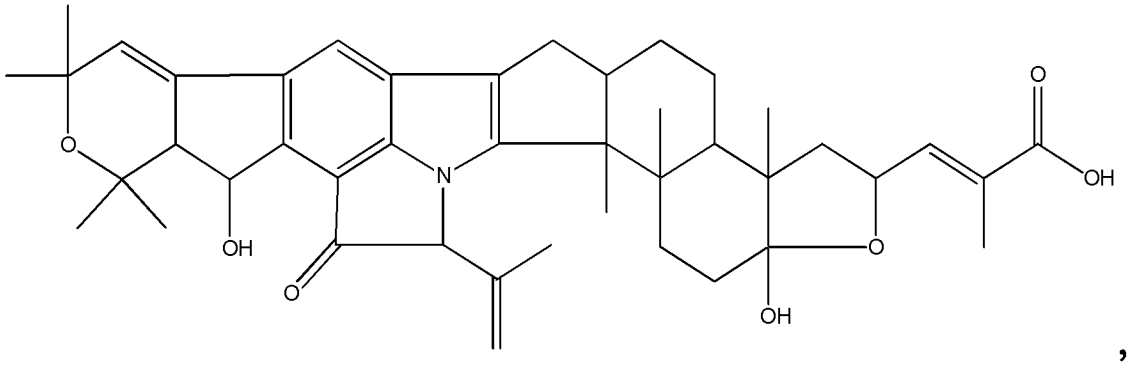
[0528]



,

[0529] 29,30- 二氢 -20,30- 氧杂 - 结袍酸 (化合物 B) :

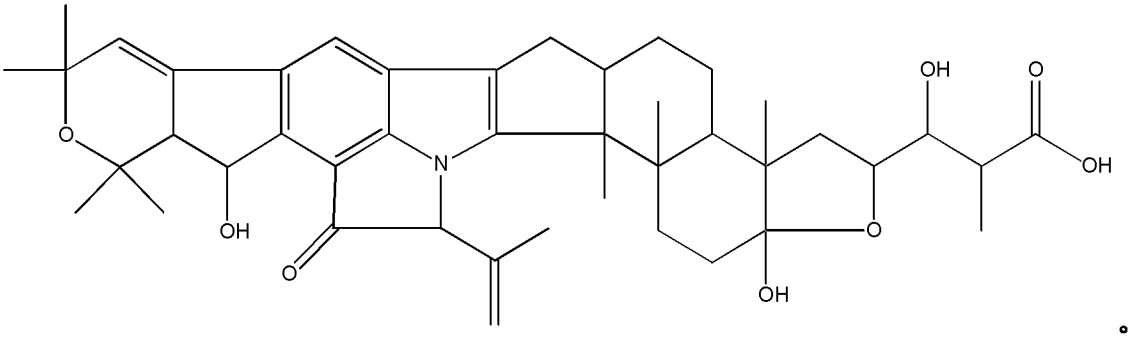
[0530]



,

[0531] 和 31- 羟基 -20,30- 氧杂 -29,30,31,32- 四氢 - 结袍酸 (化合物 C)

[0532]

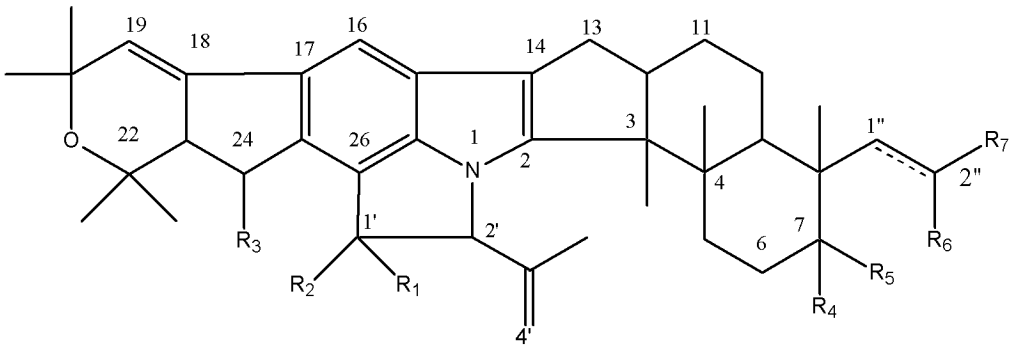


。

[0533] 这些结袍酸化合物 A、B 和 C 得自多节孢属 (Nodulisporium sp.)MF-5954(ATCC 74245) 的发酵培养物,三种结袍酸的分离和纯化揭示于 US 专利 5,399,582。这些化合物的衍生物描述于 WO 96/29073 和 US 专利号 5,945,317 ;5,962,499 ;5,834,260 ;6,399,796 ; 6,221,894 ;6,136,838 ;5,595,991 ;5,299,582 ;和 5,614,546。

[0534] 本发明组合物也包括本领域已知的全部结袍酸衍生物,所述衍生物包括全部立体异构体,如上述在先公开中描述的那些,通过引用将其并入并以下文各结构式进行描述。那些结构式的所述取代基在其后直接定义,其中独立地于上文的本发明化合物和其它化合物进行它们命名和定义。特别优选的是包含下式结袍酸衍生物的涂抹剂配制剂 :

[0535]

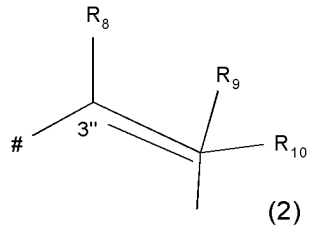


I'

[0536] 其中

[0537] R_1是 (1) 氢,(2) 任选取代的烷基,(3) 任选取代的烯基,(4) 任选取代的炔基,(5) 任选取代的环烷基,(6) 任选取代的环烯基,其中烷基、烯基、炔基、环烷基和环烯基上的所述取代基是 1 至 3 个基团,所述基团独立地选自 (i) 烷基,(ii)X-C_1-C_6- 烷基,其中 X 是 O 或 $S(O)_m$,(iii) 环烷基,(iv) 羟基,(v) 卤素,(vi) 氰基,(vii) 羧基,(viii)NY^1Y^2,其中 Y^1 和 Y^2独立地是 H 或烷基,(ix) 烷酰基氨基,和 (x) 芳酰氨基,其中所述芳酰基任选地经 1 至 3 个独立地选自 R^f的基团取代,(7) 芳基或芳基烷基,其中所述芳基任选地经 1 至 3 个独立地选自 R^f的基团取代,(8) 全氟烷基,(9)5- 或 6- 元杂环,其含 1 至 4 个独立地选自氧、硫和氮原子的杂原子,其任选被 1 至 3 个独立地选自羟基、氧代、烷基和卤素的基团取代,并且其可以是饱和或部分不饱和的,R_2,R_3,和 R_4独立地是 OR^a,OCO_2R^b,$OC(O)NR^cR^d$;或者 R_1和 R_2代表 = O,= NOR^a或 = $N-NR^cR^d$;R_5和 R_6是 H ;或者 R_5和 R_6一起代表 -O- ;R_7是 (1)CHO 或片段 (2)

[0538]



(2) ,

[0539] 其中

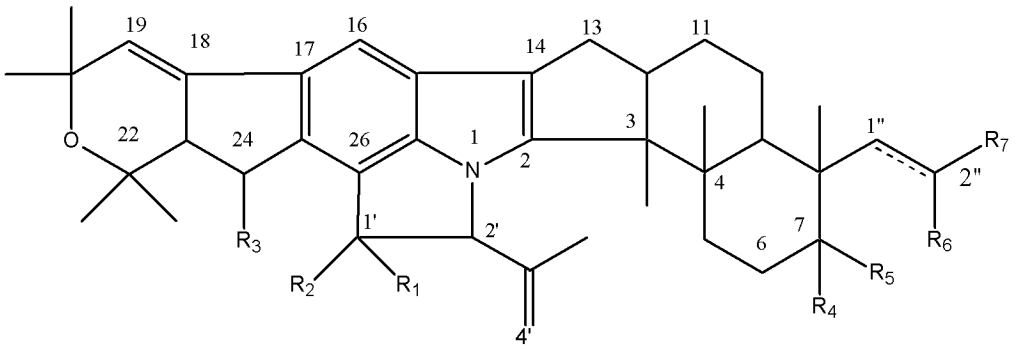
[0540] # 表示连接式 I′ 分子的键,R_8是 (1)H,(2)OR^a或 (3)NR^cR^d,R_9是 (1)H 或 (2)OR^a,R_{10}是 (1)CN,(2)$C(O)OR^b$,(3)$C(O)N(OR^b)R^c$,(4)$C(O)NR^cR^d$,(5)$NHC(O)OR^b$,(6)$NHC(O)NRCR^d$,(7)CH_2OR^a,(8)$CH_2OCO_2R^b$,(9)$CH_2OC(O)NR^cR^d$,(10)$C(O)NR^cNR^cR^d$或 (11)$C(O)NR^cSO_2R^b$;而其中 ------ 表示单键或双键,并且其中

[0541] R^a是 (1) 氢,(2) 任选取代的烷基,(3) 任选取代的烯基,(4) 任选取代的炔基,(5) 任选取代的烷酰基,(6) 任选取代的烯酰基,(7) 任选取代的炔酰基,(8) 任选取代的芳酰基,(9) 任选取代的芳基,(10) 任选取代的环烷酰基,(11) 任选取代的环烯酰基,(12) 任选取代的烷磺酰基,(13) 任选取代的环烷基,(14) 任选取代的环烯基,其中烷基、烯基、炔基、烷酰基、烯酰基、炔酰基、芳酰基、芳基、环烷酰基、环烯酰基、烷磺酰基、环烷基和环烯基上的所述取代基是 1 至 10 个独立地选自羟基、烷氧基、环烷基、芳基烷氧基、NR^gR^h、CO_2R_b、$CONR^cR^d$和卤素的基团,(15) 全氟烷基,(16) 芳基磺酰基,任选被 1 至 3 个独立地选自烷基、

全氟烷基、硝基、卤素和氰基的基团取代，或 (17)5- 或 6- 元杂环，其含有 1 至 4 个选自氧、硫和氮的杂原子，所述杂原子任选被 1 至 4 个独立地选自烷基、烯基、全氟烷基、氨基、C(O)NR^cR^d、氰基、CO_2R^b和卤素的基团取代，并且其可以是饱和或部分不饱和的；R^b是 (1)H，(2) 任选取代的芳基，(3) 任选取代的烷基，(4) 任选取代的烯基，(5) 任选取代的炔基，(6) 任选取代的环烷基，(7) 任选取代的环烯基，或 (8) 任选取代的杂环，其含有 1 至 4 个独立地选自氧、硫和氮的杂原子；其中芳基、烷基、烯基、环烷基、环烯基、杂环、或炔基上的所述取代基是 1 至 10 个独立地选自下述的基团：(i) 羟基，(ii) 烷基，(iii) 氧代，(iv)$SO_2NR^gR^h$，(v) 芳基烷氧基，(vi) 羟基烷基，(vii) 烷氧基，(viii) 羟基烷氧基，(ix) 氨基烷氧基，(x) 氰基，(xi) 巯基，(xii) 烷基 $-S(O)_m$，(xiii) 环烷基，任选被 1 至 4 个独立地选自 R^e的基团取代，(xiv) 环烯基，(xv) 卤素，(xvi) 烷酰基氧基，(xvii)C(O)NR^gR^h，(xviii)CO_2R^i，(xix) 甲酰基，(xx)$-NR^gR^h$，(xxi)5- 至 9- 元杂环，其可以是饱和或部分不饱和的，含有 1 至 4 个独立地选自氧、硫和氮的杂原子，并且任选被 1 至 5 个独立地选自 R^e的基团取代，(xxii) 任选取代的芳基，其中芳基取代基是 1,2- 甲二氧基或 1 至 5 个独立地选自 R^e的基团，(xxiii) 任选取代的芳基烷氧基，其中芳基取代基是 1,2- 甲二氧基或 1 至 5 个独立地选自 R^e的基团，和 (xxiv) 全氟烷基；R^c和 R^d独立地选自 R^b；或 R^c和 R^d一起与它们连接至的 N 形成 3- 至 10- 元环，该环含有 0 至 2 个选自 O、$S(O)_m$和 N 的另外的杂原子，所述杂原子任选被 1 至 3 个独立地选自 R^g、羟基、硫代和氧代的基团取代；R^e是 (1) 卤素，(2) 烷基，(3) 全氟烷基，(4)$-S(O)_mR^i$，(5) 氰基，(6) 硝基，(7)$R_{10}(CH_2)v-$，(8)$R^iCO_2(CH_2)v-$，(9)$R^iOCO(CH_2)v-$，(10) 任选取代的芳基，其中所述取代基是卤素、烷基、烷氧基、或羟基中的 1 至 3 个，(11)$SO_2NR^gR^h$，或 (12) 氨基；R^f是 (1) 烷基，(2)X-C_1-C_4烷基，其中 X 是 O 或 $S(O)_m$，(3) 烯基，(4) 炔基，(5) 全氟烷基，(6)NY^1Y^2，其中 Y^1和 Y^2独立地是 H 或烷基，(7) 羟基，(8) 卤素，和 (9) 烷酰基氨基，R^g和 R^h独立地是 (1) 氢，(2) 烷基，任选被羟基、氨基或 CO_2R^i取代，(3) 芳基，任选被卤素、1,2- 甲二氧基、烷氧基、烷基或全氟烷基取代，(4) 芳基烷基，其中芳基任选地经全氟烷基或 1,2- 甲二氧基取代；(5) 烷氧羰基，(6) 烷酰基，(7) 烷酰基烷基，(9) 芳基烷氧羰基，(10) 氨基羰基，(11) 单烷基氨基羰基，(12) 二烷基氨基羰基；或者 R^g和 R^h与它们连接至的 N 一起形成 3- 至 7- 元环，该环含有 0 至 2 个选自 O、$S(O)_m$和 N 的另外杂原子，所述杂原子任选被 1 至 3 个独立地选自 R^e和氧代的基团取代；R^i是 (1) 氢，(2) 全氟烷基，(3) 烷基，(4) 任选取代的芳基或芳基烷基，其中芳基取代基是 1 至 3 个独立地选自卤素、烷基、烷氧基和羟基的基团；m 是 0 至 2；而 v 是 0 至 3；或者其药学上可接受的盐。

[0542] 在优选的实施方式，本发明提供包含式 I′ 化合物的配制剂

[0543]

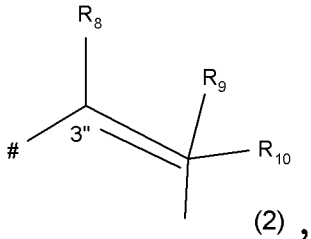


I'

[0544] 其中

[0545] R_1是 (1) 氢,(2) 任选取代的烷基,(3) 任选取代的烯基,(4) 任选取代的炔基,(5) 任选取代的环烷基,(6) 任选取代的环烯基,其中烷基、烯基、炔基、环烷基和环烯基上的所述取代基是 1 至 3 个独立地选自下述的基团 :(i) 烷基,(ii)X-C_1-C_6- 烷基,其中 X 是 O 或 $S(O)_m$,(iii) 环烷基,(iv) 羟基,(v) 卤素,(vi) 氰基,(vii) 羧基,和 (viii)NY^1Y^2,其中 Y^1 和 Y^2独立地是 H 或烷基,(7) 芳基或芳基烷基,其中所述芳基任选地经 1 至 3 个独立地选自 R^f的基团取代,(8) 全氟烷基,(9)5- 或 6- 元杂环,其含有 1 至 4 个独立地选自氧、硫和氮原子的杂原子,所述杂原子任选被 1 至 3 个独立地选自羟基、氧代、烷基和卤素的基团取代,并且其可以是饱和的或部分不饱和的,R_2,R_3,和 R_4独立地是 OR^a,OCO_2R^b,$OC(O)NR^cR^d$;或者 R_1和 R_2代表 = O,= NOR^a或 = $N-NR^cR^d$;R_5和 $R_6$are H ;或者 R_5和 R_6一起代表 -O- ;R_7是 (1)CHO 或片段 (2)

[0546]



(2) ,

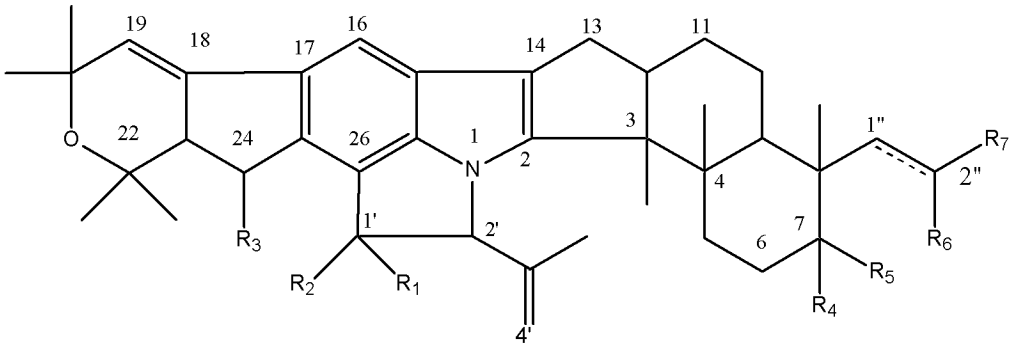
[0547] 其中

[0548] # 表示连接至式 I′ 分子的键,R_8是 (1)H,(2)OH,或 (3)NH_2;R_9是 (1)H 或 (2)OH ;R_{10}是 (1)C(O)OR^b,(2)C(O)N(OR^b)R^c,(3)C(O)NR^cR^d,(4)NHC(O)OR^b,(5)NHC(O)NR^cR^d,(6)CH_2OR^a,(7)$CH_2OCO_2R^b$,(8)$CH_2OC(O)NR^cR^d$,(9)C(O)$NR^cNR^cR^d$,或 (10)C(O)$NR^cSO_2R^b$;R^a是 (1) 氢,(2) 任选地烷基,(3) 任选取代的烯基,(4) 任选取代的炔基,(5) 任选取代的烷酰基,(6) 任选取代的烯酰基,(7) 任选取代的炔酰基,(8) 任选取代的芳酰基,(9) 任选取代的芳基,(10) 任选取代的环烷酰基,(11) 任选取代的环烯酰基,(12) 任选取代的烷磺酰基 (13) 任选取代的环烷基 (14) 任选取代的环烯基,其中烷基、烯基、炔基、烷酰基、烯酰基、炔酰基、芳酰基、芳基、环烷酰基、环烯酰基、烷磺酰基、环烷基和环烯基上的所述取代基是 1 至 10 个独立地选自羟基、烷氧基、环烷基、芳基烷氧基、NR^gR^h、CO_2R^b、$CONR^cR^d$和卤素的基团,(15) 全氟烷基,(16) 芳基磺酰基,任选被 1 至 3 个独立地选自烷基、全氟烷基、卤素和氰基的基团取代,(17)5- 或 6- 元杂环,其含有 1 至 4 个选自氧、硫和氮的杂原子,所述杂原子任选被 1 至 4 个独立地选自烷基、烯基、全氟烷基、氨基、C(O)NR^cR^d、氰基、CO_2R^b和卤素的基团取代,并且其

可以是饱和的或部分不饱和的；R^b是 (1)H，(2) 任选取代的芳基，(3) 任选取代的烷基，(4) 任选取代的烯基，(5) 任选取代的炔基，(6) 任选取代的环烷基 (7) 任选取代的环烯基，或 (8) 任选取代的 5- 至 10- 元杂环，其含有 1 至 4 个独立地选自氧、硫和氮的杂原子；其中芳基、烷基、烯基、环烷基、环烯基、杂环或炔基上的所述取代基是 1 至 10 个独立地选自下述的基团：(i) 羟基，(ii)C_1-C_3烷基，(iii) 氧代，(iv)$SO_2NR^gR^h$，(v) 芳基烷氧基，(vi) 羟基烷基，(vii) 烷氧基，(viii) 羟基烷氧基，(ix) 氨基烷氧基，(x) 氰基，(xi) 全氟烷基，(xii) 烷基 -$S(O)_m$，(xiii) 环烷基，任选被 1 至 4 个独立地选自 R^e的基团取代，(xiv) 环烯基，(xv) 卤素，(xvi) 烷酰基氧基，(xvii)$C(O)NR^gR^h$，(xviii)CO_2R^i，(xix) 任选取代的芳基烷氧基，其中芳基取代基是 1,2- 甲二氧基或 1 至 5 个独立地选自 R^e的基团，(xx)-NR^gR^h，(xxi)5 至 6- 元杂环，其可以是饱和的或部分不饱和的，含有 1 至 4 个独立地选自氧、硫和氮的杂原子，且任选被 1 至 5 个独立地选自 R^e的基团取代，和 (xxii) 任选取代的芳基，其中芳基取代基是 1,2- 甲二氧基或 1 至 5 个独立地选自 R^e的基团；R^e是 (1) 卤素，(2) 烷基，(3) 全氟烷基，(4)-$S(O)_mR^i$，(5) 氰基，(6) 氨基，(7)$R^iO(CH_2)_v$-，(8)$R^iCO_2(CH_2)_v$-，(9)$R^iOCO(CH_2)_v$-，(10) 任选取代的芳基，其中所述取代基是卤素、烷基、烷氧基或羟基中的 1 至 3 个，或 (11)$SO_2NR^gR^h$；R^f是 (1) 甲基，(2)X-C_1-C_2烷基，其中 X 是 O 或 $S(O)_m$，(3) 卤素，(4) 乙酰基氨基，(5) 三氟甲基，(6)NY^1Y^2，其中 Y^1和 Y^2独立地是 H 或甲基，和 (7) 羟基；R^g和 R^h独立地是 (1) 氢，(2) 烷基，任选被羟基、氨基或CO_2R^i取代，(3) 芳基，任选被卤素、1,2- 甲二氧基、烷氧基、烷基或全氟烷基取代，(4) 芳基烷基，其中芳基任选地经全氟烷基或 1,2- 甲二氧基取代；(5) 烷氧羰基，(6) 烷酰基，(7) 烷酰基烷基，(9) 芳基烷氧羰基，(10) 氨基羰基，(11) 单烷基氨基羰基，(12) 二烷基氨基羰基；或者 R^g和 R^h与它们连接至的 N 一起形成 5- 至 6- 元环，其含有 0 至 2 个选自 O、$S(O)_m$和 N 的另外杂原子，任选被 1 至 3 个独立地选自 R^e和氧代的基团取代；R^i是 (1) 氢，(2) 全氟烷基，(3) 烷基，(4) 任选取代的芳基烷基，其中芳基取代基是独立地选自卤素、烷基、烷氧基和羟基的 1 至 3 个基团。

[0549] 在其它优选的实施方式中，本发明提供包含式 I′ 化合物的组合物

[0550]



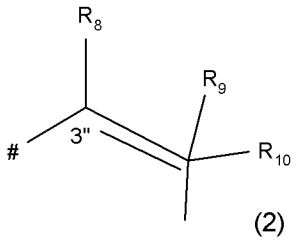
I'

[0551] 其中

[0552] R^1是 (1) 氢，(2) 任选取代的烷基，(3) 任选取代的烯基，(4) 任选取代的炔基，其中烷基、烯基和炔基上的所述取代基是 1 至 3 个独立地选自下述的基团：(i) 甲基，(ii)X- 甲基，其中 X 是 O 或 $S(O)_m$和 (iii) 卤素，(5) 芳基或芳基烷基，其中所述芳基任选地经 1 至 3 个独立地选自 R^f的基团取代，(6) 三氟甲基；R_2，R_3，和 R_4独立地是 OR^a，OCO_2R^b，$OC(O)NR^cR^d$；

或者 R_1和 R_2代表＝ O，＝ NOR^{a}或＝ N-NR^{c}R^d；R_5和 R_6是 H；或者 R_5和 R_6一起代表 -O-；R_7是 (1)CHO 或片段 (2)

[0553]



(2)，

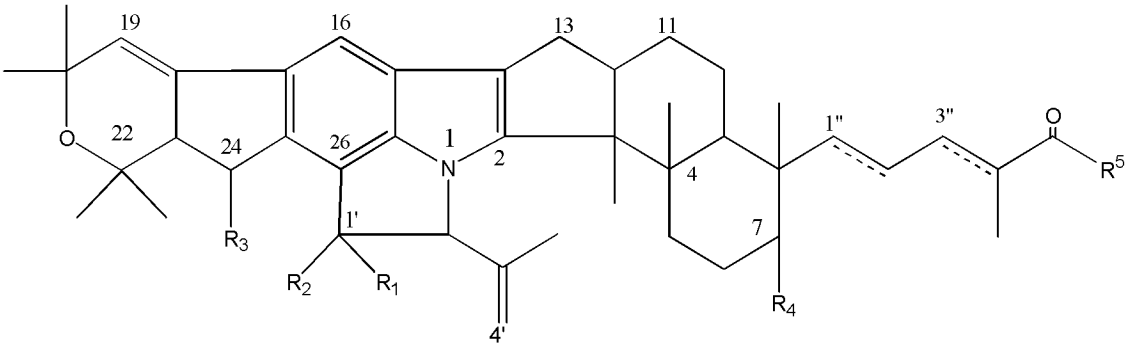
[0554] 其中

[0555] #表示连接至式 I′ 分子的键；R_8是 (1)H，(2)OH，或 (3)NH_2 R_9是 (1)H，或 (2)OH；R_{10}是 (1)C(O)OR^b，(2)C(O)N(OR^b)R^c，(3)C(O)NR^{c}R^d，(4)NHC(O)OR^b，(5)NHC(O)NR^{c}R^d，(6)CH_2OR^a，(7)CH_2OCO$_2$R^b，(8)CH_2OC(O)NR^{c}R^d，(9)C(O)NR^{c}NR^{c}R^d，或 (10)C(O)NR^{c}SO$_2$R^b；R^{a}是 (1) 氢，(2) 任选取代的烷基，(3) 任选取代的烯基，(4) 任选取代的炔基，(5) 任选取代的烷酰基，(6) 任选取代的芳酰基，(7) 任选取代的环烷酰基，(8) 任选取代的环烯酰基，(9) 任选取代的烷磺酰基，其中烷基、烯基、炔基、烷酰基、芳酰基、环烷酰基、环烯酰基和烷磺酰基上的所述取代基是 1 至 5 个独立地选自羟基、烷氧基、芳基烷氧基、NR^{g}R^h、CO$_2$R^b、CONR^{c}R^{d}和卤素的基团，(10) 三氟甲基，(11) 芳基磺酰基，任选被 1 至 3 个独立地选自甲基、三氟甲基和卤素的基团取代，(12)5- 或 6- 元杂环，含有 1 至 4 个选自氧、硫和氮的杂原子，所述杂原子任选被 1 至 4 个独立地选自甲基、三氟甲基、C(O)NR^{c}R^d、CO$_2$R^{b}和卤素的基团取代，并且其可以是饱和的或部分不饱和的；R_b是 (1)H，(2) 任选取代的芳基，(3) 任选取代的烷基，(4) 任选取代的烯基，(5) 任选取代的炔基，(6) 任选取代的环烷基，(7) 任选取代的环烯基，或 (8) 任选取代的 5- 至 6- 元杂环，其含有 1 至 4 个独立地选自氧、硫和氮的杂原子；其中芳基、烷基、烯基、环烷基、环烯基、杂环或炔基上的所述取代基是 1 至 10 个独立地选自下述的基团：(i) 羟基，(ii) 烷基，(iii) 氧代，(iv)SO$_2$NR^{g}R^h，(v) 芳基烷氧基，(vi) 羟基烷基，(vii) 烷氧基，(viii) 羟基烷氧基，(ix) 氨基烷氧基，(x) 氰基，(x i) 烷基 -S(O)$_m$，(xii) 环烷基，任选被 1 至 4 个独立地选自 R^{e}的基团取代，(xiii) 环烯基，(xiv) 卤素，(xv) 烷酰基氧基，(xvi)C(O)NR^{g}R^h，(xvii)CO$_2$R^i，(xvii)-NR^{g}R^h，(xix)5 至 6- 元杂环，其可以是饱和的或部分不饱和的，含有 1 至 4 个独立地选自氧、硫和氮的杂原子，其任选被 1 至 5 个独立地选自 R^{e}的基团取代，(xx) 任选取代的芳基，其中芳基取代基是 1,2- 甲二氧基或 1 至 5 个独立地选自 R^{e}的基团，(xxi) 任选取代的芳基烷氧基，其中芳基取代基是 1,2- 甲二氧基或 1 至 5 个独立地选自 R^{e}的基团，和 (xxii) 全氟烷基；R^{e}是 (1) 卤素，(2) 烷基，(3) 全氟烷基，(4)-S(O)$_m$R^i，(5) 氰基，(6)R^{i}O(CH$_2$)$_v$-，(7)R^{i}CO2(CH$_2$)$_v$-，(8)R_{10}CO(CH$_2$)$_v$-，(9) 任选取代的芳基，其中所述取代基是卤素、烷基、烷氧基或羟基中的 1 至 3 个，(10)SO$_2$NR^{g}R^h，或 (11) 氨基；R^{f}是 (1) 甲基，(2)X-C_1-C_2烷基，其中 X 是 O 或 S(O)$_m$，(3) 三氟甲基，(4)NY^{1}Y^2，其中 Y^{1}和 Y^{2}独立地是 H 或甲基，(5) 羟基，(6) 卤素，和 (7) 乙酰基氨基，R^{g}和 R^{h}独立地是 (1) 氢，(2) 烷基，任选被羟基、氨基或 CO$_2$R^{i}取代，(3) 芳基，任选经卤素、1,2- 甲二氧基、烷氧基、烷基或全氟烷基取代，(4) 芳基烷基，其中芳基任选地经全氟烷基或 1,2- 甲二氧基取代；(5) 烷氧羰基，(6) 烷酰基，(7) 烷酰基烷基，(9) 芳基烷氧羰基，(10) 氨基羰基，(11) 单烷基氨基羰基 (12) 二烷基氨基羰基；或 R^{g}和 R^{h}与它们连接至的 N 一起形成 5- 至 6- 元环，其含有 0 至 2 个选自

O、$S(O)_m$和 N 的另外的杂原子，任选被 1 至 3 个独立地选自 R^e和氧代的基团取代；R^i是 (1) 氢，(2) 全氟烷基，(3) 烷基，(4) 任选取代的芳基或芳基烷基，其中芳基取代基是 1 至 3 个独立地选自卤素、烷基、烷氧基和羟基的基团；并且全部其它变量如上文对式 I′ 的定义。

[0556] 最特别优选的是这样的配制剂，其中所述组合物包含结袍酸衍生物，其是下式化合物的结袍酰胺 (nodulisporamide)

[0557]



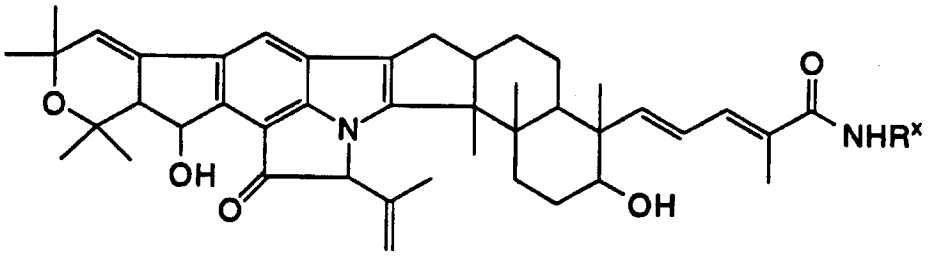
[0558] 其中

[0559] R_1为氢，任选取代的 C_1-C_{10}烷基，任选取代的 C_2-C_{10}烯基，任选取代的 C_2-C_{10}炔基，任选取代的 C_3-C_8环烷基，任选取代的 C_5-C_8环烯基，其中烷基、烯基、炔基、环烷基和环烯基上的所述取代基是 1 至 3 个独立地选自下述的基团：C_1-C_5烷基，C_1-C_{10}烷氧基，C_1-C_{10}烷硫基，C_1-C_{10}烷磺酰基，C_3-C_8环烷基，羟基，卤素，氰基，羧基，氨基，C_1-C_{10}单烷基氨基，C_1-C_{10}二烷基氨基，C_1-C_{10}烷酰基氨基和苯甲酰基氨基，其中所述苯甲酰基任选地经 1 至 3 个独立地选自下述的基团取代：C_1-C_4烷基，C_1-C_4烷氧基，C_1-C_4烷硫基，C_2-C_4烯基，C_2-C_4炔基，C_1-C_3- 全氟烷基，氨基，羟基，卤素，C_1-C_5单烷基氨基，C_1-C_5二烷基氨基和 C_1-C_5烷酰基氨基，(7) 苯基 C_0-C_5烷基，其中所述苯基任选地经 1 至 3 个独立地选自下述的基团取代：C_1-C_4烷基，C_1-C_4烷氧基，C_1-C_4烷硫基，C_2-C_4烯基，C_2-C_4炔基，C_1-C_3- 全氟烷基，氨基，羟基，羧基，卤素，C_1-C_5单烷基氨基，C_1-C_5二烷基氨基和 C_1-C_5烷酰基氨基，(8)C_1-C_5全氟烷基，(9) 选自 4- 吗啉基、吡啶基和哌嗪基的 5 元环或 6 元环，其任选被 1 至 3 个独立地选自羟基、氧代、C_1-C_{10}烷基和卤素的基团取代，R^2、R^3和 R^4独立地是 OR^a，OCO_2R^b，$OC(O)NR^cR^d$；或者 R^1和 R^2一起代表＝ O，＝ NOR^a或＝ N-NR^cR^d；R^5是 NR^cR^d；R^a是 (1) 氢，(2) 任选取代的 C_1-C_{10}烷基，(3) 任选取代的 C_3-C_{10}烯基，(4) 任选取代的 C_3-C_{10}炔基，(5) 任选取代的 C_1-C_{10}烷酰基，(6) 任选取代的 C_1-C_{10}烯酰基，(7) 任选取代的 C_1-C_{10}炔酰基，(8) 任选取代的苯甲酰基，(9) 任选取代的苯基，(10) 任选取代的 C_1-C_7环烷酰基，(11) 任选取代的 C_4-C_7环烯酰基，(12) 任选取代的 C_1-C_{10}烷磺酰基，(13) 任选取代的 C_3-C_8环烷基，(14) 任选取代的 C_5-C_8环烯基，其中烷基、烯基、炔基、烷酰基、烯酰基、炔酰基、苯甲酰基、苯基、环烷酰基、环烯酰基、烷磺酰基、环烷基和环烯基上的所述取代基是 1 至 5 个独立地选自羟基、C_1-C_6烷氧基、C_3-C_7环烷基、芳基 C_1-C_3烷氧基、NR^gR^h、CO_2R^b、$CONR^cR^d$和卤素的基团，(15)C_1-C_5全氟烷基，(16) 苯基磺酰基，任选被 1 至 3 个独立地选自 C_1-C_5烷基、C_1-C_5全氟烷基、硝基、卤素或氰基的基团取代，(17) 选自 1- 哌啶基、4- 吗啉基、吡啶基和哌嗪基的 5 元环或 6 元环，其任选被 1 至 4 个独立地选自 C_1-C_5烷基、C_1-C_5烯基、C_1-C_5全氟烷基、氨基、$C(O)R^cR^d$、氰基、CO_2R^b或卤素的基团取代；R^b是 (1)H，(2) 任选取代的苯基，(3) 任选取代的 C_1-C_{10}烷基，(4) 任选取代的 C_3-C_{10}烯基，或 (5) 任选取代的 C_3-C_{10}炔基，其中苯基、烷基、烯基或炔基上的所述取代基是 1 至 5

个独立地选自下述的基团：羟基，C_1-C_6烷氧基，C_3-C_7环烷基，卤素，C_1-C_5烷酰基氧基，C(O)NR^cR^d，CO_2R^b，甲酰基，$-NR^gR^h$，任选取代的苯基，和任选取代的苯基C_1-C_3烷氧基，其中苯基取代基是 1 至 3 个独立地选自R^e的基团；R^c和R^d独立地是R^b；或R^c和R^d与它们连接至的 N 一起形成 1- 哌啶基，4- 吗啉基或哌嗪基，其任选被 1 至 3 个独立地选自R^g和氧代的基团取代；R^e是 (1) 卤素，(2)C_1-C_7烷基，(3)C_1-C_3全氟烷基，(4)$-S(O)_mR^i$，(5) 氰基，(6) 硝基，(7)$R^jO(CH_2)_v-$，(8)$R^jCO_2(CH_2)_v-$，(9)$R^jOCO(CH_2)_v^-$，(10) 任选取代的苯基，其中所述取代基是 1 至 3 个卤素，C_1-C_6烷基，C_1-C_6烷氧基，或羟基；v 是 0 至 3；R^g和R^h独立地是 (1) 氢，(2)C_1-C_6烷基，(3) 芳基，(4) 芳基C_1-C_6烷基，(5)C_1-C_5烷氧羰基，(6)C_1-C_5烷基羰基，或 (7)C_1-C_5烷酰基C_1-C_5烷基；或R^g和R^h与它们连接至的 N 一起形成 1- 哌啶基，4- 吗啉基或哌嗪基，其任选被 1 至 3 个独立地选自R^g和氧代的基团取代；R^i和R^j独立地是 (1) 氢，(2)C_1-C_3全氟烷基，(3) 任选取代的C_1-C_6烷基，其中所述取代基是芳基或经取代的苯基；(4) 苯基或经取代的苯基，其中所述取代基是 1 至 3 个独立地选自卤素、C_1-C_6烷基、C_1-C_6烷氧基或羟基的基团；m 是 0 至 2；或者其药学上可接受的盐。

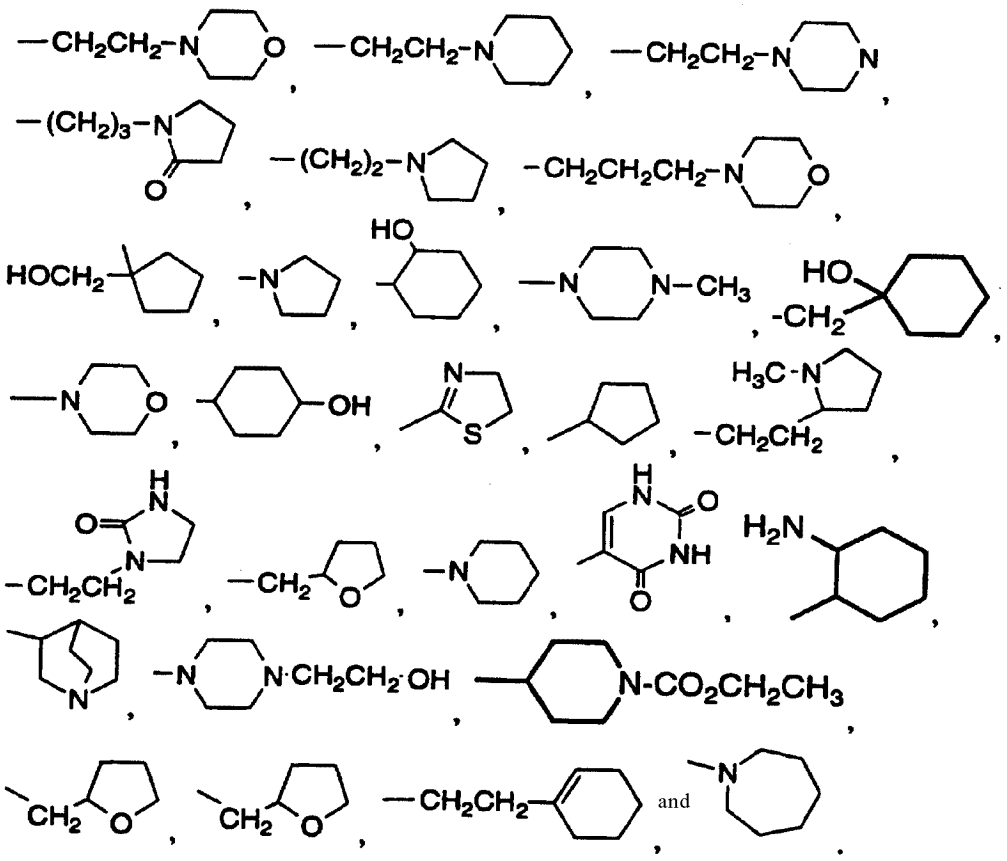
[0560] 最特别优选的是包含下式化合物的组合物

[0561]



[0562] 其中R^x选自下组：H，CH_3，CH_2CH_3，$C(CH_3)_3$，$CH_2CH_2CH_3$，CH_2CH_2OH，$CH(CO_2CH_3)CH_2OH$，$CH_2CO_2CH_3$，$CH_2CH(OCH_2CH_3)_2$，$CH_2CH_2OCH_2CH_2OH$，$CH(CH_3)(CH_2)_3C(CH_3)_2OH$，$(CH_2)_3OH$，$(CH_2)_4OH$，$(CH_2)SOH$，$CH(CH_2OH)CH_2CH_3$，$NHC(CH_3)_3$，$CH_2CN$，$(CH_2)_6OH$，$CH_2CH(OH)CH_3$，$CH(CH_2OH)CH_2CH_2CH_3$，$CH_2CH_2SCH_3$，$CH_2CH_2SCH_2CH_3$，$CH_2CONH$，$CH(CH_3)(CH_2OH)_2$，$CH_2CH_2NHCH_2CH_2OH$，$CH(CH_2OH)(CH_2)_3CH_3$，$CH(CH_2OCH_3)CH_3$，$(CH_2)_2SH$，$(CH_2)_4NH_2$，$CH_2CH_2SO_2CH_3$，$CH_2CH_2S(O)CH_3$，$CH(CH(CH_3)_2)CH_2OH$，$(CH_2)_3NH_2$，$(CH_2)_3N(CH_2CH_3)_2$，$(CH_2)_3N(CH_3)_2$，$OCH_2CH_3$，$CH_2CH(OH)CH_2OH$，$OCH_3$，$CH_2CH_2OCH_3$，$CH_2CH_2NHC(O)CH_3$，$C(CH_3)_2CH_2OH$，$c-C_3H_5$，$c-C_6H_{11}$，$(CH_2)_3OCH_2CH_3$，$CH_2CH\equiv CH_2$，$C(CH_2CH_3)(CH_2OH)_2$，$CH_2C\equiv CH$，$CH_2CO_2CH_2CH_3$，$CH_2CH_2F$，$(CH_2)_3OCH_2)_{11}CH_3$，$CH_2CH_2N(CH_3)_2$，$CH_2CH_2OCH_2CH_2NH_2$，$CH_2CF_3$，$NHCH_2CO_2CH_2CH_3$，$CH(CH_3)CO_2CH_3$，$C(CH_3)_2CH_2C(O)CH_3$，$CH(CO_2CH_2CH_3)_2$，$CH_2CH_3$，$CH(CH_2CH_2CH_3)CO_2CH_3$，$CH_2CH_2CH_2OCH_3$，$C(CH_3)_2C\equiv CH$，$(CH_2)_4CH_3$，$CH(CH_2CH_2CH_3)_2$，$(CH_2)_5CH_3$，$CH_2CH_2CO_2H$，$CH(CH(CH_3)_2)CO_2CH_3$，$OCH_2CO_2H$，$CH(CH(CH_3)_2)CH_2OH$，$CH(CH(CH_3)_2)CH_2OH$，$CH(CH_3)CH_2OH$，$CH(CH_3)CH_2OH$，$CH(CH_3)_2$，$C(CH_3)_3$，$(CH_2)CH(CH_3)_2$，$CH(CH_3)CH_2CH_3$，$CH_2CH(CH_3)OH$，$(CH_2)_3CH_3$，$(CH_2)_2OCH_2CH_3$，1- 金刚烷基，$(CH_2)_8CH_3$，$CH(CH_3)CH(CH_3)_2$，$(CH_2)_3NHCH_3$，$(CH_2)_2N(CH_2CH_3)_2$，

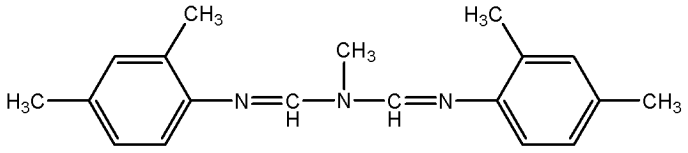
[0563]



[0564] 用于本发明组合物特别优选的结袍酰胺化合物是那些，其中 R^X 是 t- 丁基（或“结袍酰胺”）。

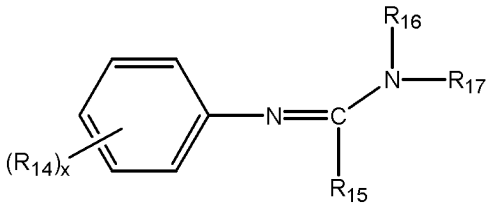
[0565] 在本发明另一实施方式中，式 I 化合物可以与甲脒化合物组合给予。甲脒类化合物包括但不限于，阿米曲士 (amitraz)(Mitaban®, Pfizer ;Point-Guard®, Intervet ; Preventic®, Virbac ;Taktic®, Intervet)，杀虫脒 (chlordimeform)，丁甲虫脒 (chloromebuform)，伐虫脒 (formetanate) 和胺甲威 (formparanate)。阿米曲士 (amitraz) 是熟知的甲脒类杀疥虫剂 / 杀昆虫剂，已承认其可用作杀疥螨剂和用于防除蜱。参见 Plumb′ s Veterinary Drug Handbook(Fifth Edition), ed. Donald C. Plumb, Blackwell Publishing, pg. 34, (2005)。甲脒类杀虫剂的特点是特征的 -N = CR-NR′ - 部分。阿米曲士 (amitraz) 与甲脒类其它成员之处在于化合物中存在二个上述部分。阿米曲士 (amitraz) 具有以下结构：

[0566]



[0567] 在一种实施方式中，式 I 化合物与一种或多种式 (3) 甲脒化合物组合给予：

[0568]



(3)

[0569] 其中：

[0570] x 是 0-5 的整数；

[0571] R_{14}是烷基，卤素或 -OC(= O)NR $_a$R$_b$，其中 R_a和 R $_b$独立地是氢或烷基；

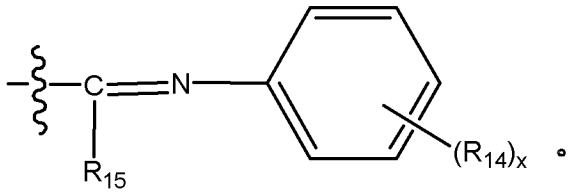
[0572] 其中 R_a和 R $_b$独立地是氢或烷基；

[0573] R_{15}为氢或烷基；

[0574] R_{16}为氢或烷基；

[0575] R_{17}为氢，烷基或

[0576]



[0577] 可以与式 I 化合物组合给予的其它类化合物包括但不限于 2- 酰基 -4- 氧代 - 吡嗪基 - 异喹啉衍生物，如吡喹酮 (praziquantel) 或 1,4.5,6- 四氢 -2-[2- 取代] 乙烯基嘧啶类和 2-[(2- 经取代的) 乙烯基]-2- 咪唑啉如噻嘧啶 (pyrantel)(参见美国专利 3,502,661，通过引用加入本文)。

[0578] 式 I 杀寄生物剂与另外的杀寄生物剂的重量比可以是约 5/1 至约 20,000/1。

[0579] 本发明杀寄生虫化合物和有关的杀内外寄生物剂可以包含在控制释放和持续释放制剂中，例如微球，颗粒剂或植入物中。它们可以例如通过在适宜的媒介物如水、油或中链甘油三酯中将杀外寄生虫药如氟虫腈 (fipronil) 的控制释放制剂，和 / 或杀内外寄生物剂如伊维菌素 (ivermectin) 的控制释放制剂进行混合来获得。

[0580] 在此种控制释放制剂中，优选地配置配制剂以释放 5 至 100mg/kg/ 天例如 45mg/kg/ 天的式 I 化合物，和 0.01 至 15mg/kg/ 天的杀外寄生虫药例如氟虫腈 (fipronil)，或者例如 0.5mg/kg/ 天的杀内外寄生物剂如伊维菌素 (ivermectin)。

[0581] 在此种控制释放制剂情况下，很长持续时间地处理动物的剂量优选地包含式 I 化合物和 1 至 20mg/kg 的氟虫腈 (fipronil) 或 2mg/kg 至 3mg/kg 的杀内外寄生物剂特别是伊维菌素 (ivermectin)。

[0582] 在本发明优选的实施方式中，包含式 I 化合物的组合物进行皮肤地 / 局部地施用。

[0583] 在其它优选的实施方式中，局部施用以含化合物的成型制品如项圈、圆形装饰、耳标、身体固定贴和粘合条和箔材形式进行。

[0584] 一般有利的是，在三周过程中以 10mg/kg 至 300mg/kg，优选 20mg/kg 至 200mg/kg，最优选 25mg/kg 至 160mg/kg 经处理动物体重的总量来施用释放式 I 化合物的固体配制剂。

[0585] 为了制备成型制品，使用热塑性和柔性塑料以及弹性体和热塑性弹性体。适宜的

塑料和弹性体是与式 I 化合物足够相容的聚乙烯基树脂，聚氨酯，聚丙烯酸类，环氧树脂，纤维素，纤维素衍生物，聚酰胺和聚酯。用于成型制品的塑料和弹性体以及制备程序的详细清单提供于例如 WO 03/086075 中。

[0586] 提供以下合成和生物实施例以阐明本发明，但是并不以任意方式解释为限制本发明范围。

实施例

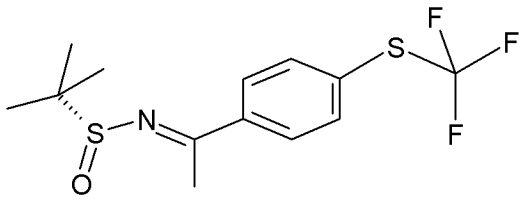
[0587] 现在，通过以下实施例进一步详细说明本发明。

[0588] S. 合成实施例

[0589] S.1 合成 (5- 氯 - 噻吩并 [2,3-d] 嘧啶 -4- 基)-[(S)-1-(4- 三氟甲基硫烷基 - 苯基)- 乙基]- 胺 (化合物 C.3-S)

[0590] 步骤 1 :合成 2- 甲基 - 丙烷 -2-(R)- 亚磺酸 [1-(4- 三氟甲基硫烷基 - 苯基)- 亚乙基]- 酰胺 (S.1)

[0591]

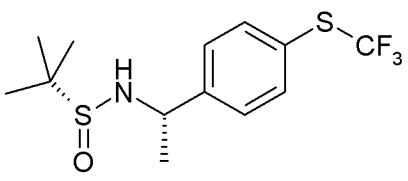


(S.1)

[0592] 将 5.44g(24.7mmol)4-(三氟甲硫基)- 苯乙酮溶于 100ml THF，随后加入 9.33ml(9.40g ;41.2mmol)$Ti(OEt)_4$。分批加入 2.50g(20.6mmol)(R)-(+)-2- 甲基 -2- 丙烷亚磺酰胺。在 65℃搅拌混合物 16h。冷却至室温后，除去溶剂，将乙酸乙酯加至残余物。仔细地加水。过滤除去沉淀，用乙酸乙酯彻底洗涤。弃去沉淀。对于滤液，层被分离，含水层用乙酸乙酯萃取 2 次。合并的有机层经 Na_2SO_4 干燥，除去溶剂，获得约 7g 粗制产品。粗制产品在硅胶 (环己烷 / 乙酸乙酯) 上纯化，获得约 4.9g 希望产品。

[0593] 步骤 2 :2- 甲基 - 丙烷 -2-(R)- 亚磺酸 [(S)-1-(4- 三氟甲基硫烷基 - 苯基)- 乙基]- 酰胺 (S.1)

[0594]

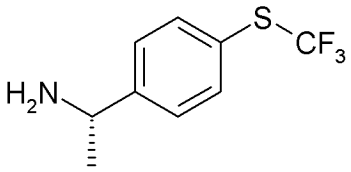


(S.2)

[0595] 将 5.6g(17.3mmol)(4a) 溶于 60ml THF，冷却至 0℃。缓慢地加入，52ml 的 1.0M 三仲丁基硼氢化钠 (L-selectride) 的 THF 溶液。在该温度继续搅拌 30min。让混合物温热至室温，继续搅拌 2h。

[0596] 步骤 3 :(S)-1-(4- 三氟甲基硫烷基 - 苯基)- 乙胺 (S.3)

[0597]

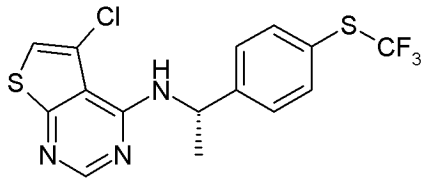


(S. 3)

[0598] 将3.50g(10.8mmol)(S.2)溶于40ml甲醇,在10℃用注射器加入5.4ml(21.6mmol)的4N HCl溶液。移除冷却浴,于室温下继续搅拌2h。除去溶剂,加水。溶液用二氯甲烷萃取2次。加入Na_2CO_3-溶液将含水层调节为碱性pH,含水层用二氯甲烷萃取3次。合并有机层,经Na_2SO_4干燥。除去溶剂,获得2.27g的无色油。对映体分析显示>99:<1的(S)-对映体优势的对映体比。

[0599] 步骤4:合成(5-氯-噻吩并[2,3-d]嘧啶-4-基)-[(S)-1-(4-三氟甲基烷硫基-苯基)-乙基]-胺(化合物C.3-S)

[0600]



[0601] 将2.07g(10.1mmol)4,4-二氯-噻吩并-[2,3-d]-嘧啶,0.94g三乙基胺(9.2mmol)和155mg(0.42mmol)碘化四丁基铵在100ml甲苯中进行混合。加入1.85g(8.4mmol)(S.3),将混合物加热至回流15h。冷却至室温之后,除去溶剂,加水至残余物。含水层用二氯甲烷萃取3次。随后,合并的有机层用1N HCl和水洗涤,经Na_2SO_4干燥。除去溶剂,残余物在硅胶(环己烷/乙酸乙酯)上纯化,获得2.37g的化合物C.3-S。

[0602] 本发明的其它式I化合物能够如上所述的合成实施例类似地制备。

[0603] C.化合物实施例

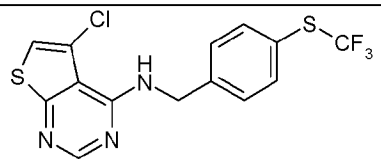
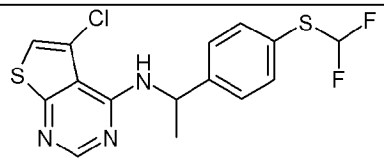
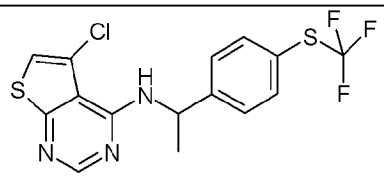
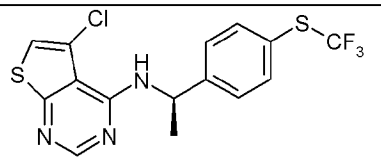
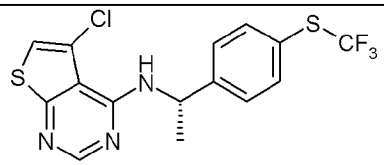
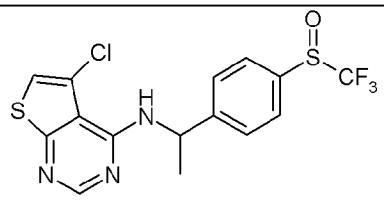
[0604] 用于根据本发明的方法中的优选化合物的某些实例通过它们的物理数据表征于下表C。

[0605] 化合物实施例通过例如高效液相色谱法/质谱联用(HPLC/MS)或它们的熔点来表征。

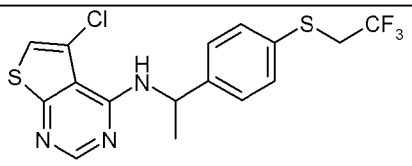
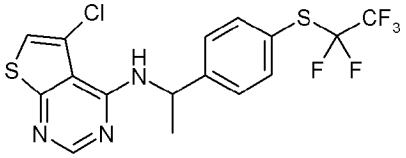
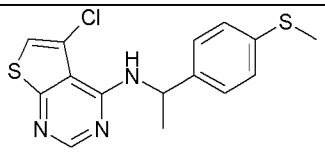
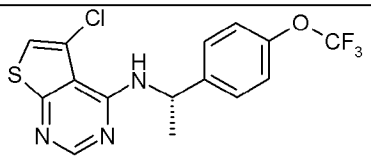
[0606] 分析型HPLC柱:RP-18柱Chromolith Speed ROD,来自Merck KgaA,德国)。洗脱液:乙腈+0.1%三氟乙酸(TFA)/水+0.1%三氟乙酸(TFA),在40℃5分钟内比例从5:95到95:5。

[0607] 表C:

[0608]

化合物实施例编号	结构	物理化学数据：HPLC-MS：t_r [min]；m/z 或 m_p =熔点[℃]
C.1		t_r = 3.871 min m/z: 376.05 g/mol
C.2		t_r = 3.659 min m/z: 371.70 g/mol
C.3		t_r = 4.231 min m/z: 390.05 g/mol
C.3-R		t_r = 4.231 min m/z: 390.05 g/mol
C.3-S		t_r = 4.231 min m/z: 390.05 g/mol
C.4		t_r = 3.283 min m/z: 405.60 g/mol

[0609]

化合物实施例编号	结构	物理化学数据：HPLC-MS：t_r [min]；m/z 或 m_p =熔点[℃]
C.5		t_r = 3.955 min m/z：404.15 g/mol
C.6		t_r = 4.295 min m/z：439.60 g/mol
对比实施例 CE.1		t_r = 3.858 min m/z：335.80 g/mol
对比实施例 CE.2		m_p = 79-80℃

[0610] B. 生物的实例作用对抗害虫

[0611] 在一般条件下，如果没有另外指定，绝大多数测试溶液制备如下：将活性化合物以所希望的浓度溶于 1 ： 1（体积：体积）蒸馏水：丙酮的混合物中。测试溶液在使用当天制备。

[0612] 测试溶液一般制备为 1000ppm，500ppm，300ppm，100ppm 和 30ppm（重量 / 体积）的浓度。

[0613] B.1 豇豆蚜虫（豆蚜 (Aphis craccivora)）

[0614] 将盆栽豇豆植物用各阶段的约 100-150 只蚜虫定居，在已记录害虫群体之后喷雾。在 24、72 和 120 小时之后评价群体减少。

[0615] 在该测试中，化合物 C.1，C.2，C.3，C.4，C.5 和 C.6 与未处理对照相对比在 300ppm 显示超过 80％死亡率。

[0616] B.2 六点黄蜘蛛 (Spider Mite)（叶螨属 (Tetranychus spp.)）

[0617] 接触 / 口服活性：

[0618] 将盆栽棉花植物用各阶段的约 50 只六点黄蜘蛛定居，在已记录害虫群体之后喷雾。在 24、72 和 120 小时之后评价群体减少（或增加）。

[0619] 在该测试中，化合物 C.3 和 C.6 与未处理对照相对比在 300ppm 显示超过 80％死亡率。

[0620] B.3 褐飞虱

[0621] 在喷雾之前 24 小时清洁并洗涤稻幼苗。将活性化合物配制于 50 ： 50 丙酮：水（体积：体积）中，加入 0.1％ vol/vol 表面活性剂 (EL 620)。将盆栽稻幼苗用 5ml 测试溶液喷雾，空气干燥，置于笼中，用 10 只成虫接种。将经处理的稻植物保持在约 28-29℃和约 50-60％的相对湿度下。在 72 小时之后记录百分比死亡率。

[0622] 在该测试中，化合物 C.3 和 C.6 与未处理对照相对比在 300ppm 显示超过 80％死亡率。

[0623] B.4 对抗埃及伊蚊的活性

[0624] 将化合物配制于 100％ DMSO 中，在含有 180ul 1X Luria 肉汤培养基和 10 只新生埃及伊蚊幼虫的微量滴定板中进行测试。基于幼虫运动性与仅含 DMSO 的对照孔中幼虫的平均运动性相比来确定化合物的效力。在剂量反应试验中测试在浓度 10ppm 运动性降低＞ 80％的化合物以确定 EC50 值。

[0625] 在该测试中，化合物 C.1，C.2，C.3，C.4，C.5 和 C.6 显示＜ 1ppm 的 EC50 值。

[0626] B.5 大鼠杀外寄生虫模型中的活性

[0627] 将大鼠用 50 只猫栉首蚤侵染。约二十四小时之后，将大鼠 (3 只每组) 用剂量 20mg/kg 或 10mg/kg 体重的测试化合物来进行局部处理。各研究中包括安慰剂 (媒介物) 和阳性对照组。处理 48 小时之后，用蚤篦从各只大鼠收集蚤。百分比效力每处理组用下式计算 ：

[0628] ％效力＝ 100x(C-T)/C

[0629] 其中 C 是安慰剂组回收的存活蚤数的几何平均值，而 T 是各处理组中回收的蚤数的几何平均值。

[0630] 化合物 C.3-S 在 20mg/kg 和 10mg/kg 剂量分别以 89％和 71％的平均值减少蚤计数 (n ＝ 2[重复次数])。

[0631] CB. 对比生物实施例

[0632] 下表 CB.1 和 CB.2 显示的生物活性这样的等级评价 :0％，显示无生物活性，直至 100％，具有全防除。如上所述地进行生物测试。

[0633] CB 1. 对比生物测试 1 ：

[0634] 与例如公开于 WO 2006/047397，其中的化合物编号 42) 的对比实施例 CE.1 和公开于 WO2007/135029(其中的化合物 C.2) 的对比实施例 CE.2 相比本发明化合物显示令人惊奇地出乎意料的更高生物活性。

[0635] 表 CB.1.1 对比化合物 CE.1 的活性

[0636]

生物	浓度 [ppm]	化合物实施例 C.3 活性 [％]	对比实施例 CE.1 活性 [％]
褐飞虱	300	100	0
六点黄蜘蛛	300	90	n.a.*

[0637] ＊化合物 CE.1 在 500ppm 具有 50％的活性

[0638] 表 CB.1.2 对比化合物 CE.2 的活性

[0639]

生物	浓度 [ppm]	化合物实施例 C.3 活性 [％]	对比实施例 CE.2 活性 [％]
六点黄蜘蛛	300	90	50

[0640] CB.2 对比生物测试 2：

[0641] 对于本发明化合物，也与本领域的立体异构化合物对比（例如公开于 WO2007/135029 的对比实施例 CE.2（其中的化合物 C.2），S- 对映异构体能进一步展示较高生物活性。

[0642] 表 CB.2.1 不同立体异构体的活性

[0643]

生物	浓度[ppm]	化合物实施例 3 立体异构体活性[%]		
		C.3	C.3-R	C.3-S
褐飞虱	300	100	0	100
六点黄蜘蛛	300	90	0	90
牛豌豆蚜虫	300	100	0	100
埃及伊蚊	EC_{50}	活性，1 [ppm]		
		C.3	C.3-R	C.3-S
	EC50	0.29	0	0.21

[0644] 表 CB.2.2 立体异构体对比化合物 CE.2 的活性

[0645]

生物	浓度[ppm]	化合物实施例 C.3-S 活性[%]	对比实施例 CE.2 活性[%]
六点黄蜘蛛	300	90	50
猫栉首蚤	剂量[mg/kg]	效力[%]	
	10	71	70
	20	89	82