



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 110869370 B

(45) 授权公告日 2023.04.11

(21) 申请号 201880045654.2

(22) 申请日 2018.05.04

(65) 同一申请的已公布的文献号
申请公布号 CN 110869370 A

(43) 申请公布日 2020.03.06

(30) 优先权数据
62/503,369 2017.05.09 US
62/548,489 2017.08.22 US(85) PCT国际申请进入国家阶段日
2020.01.08(86) PCT国际申请的申请数据
PCT/US2018/031097 2018.05.04(87) PCT国际申请的公布数据
W02018/208595 EN 2018.11.15(73) 专利权人 FMC公司
地址 美国宾夕法尼亚

(72) 发明人 C·W·小霍利奥克

(74) 专利代理机构 永新专利商标代理有限公司
72002

专利代理师 张晓威

(51) Int.Cl.
C07D 471/04 (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01)
A61P 33/00 (2006.01)(56) 对比文件
CN 103459387 A, 2013.12.18
CN 102686570 A, 2012.09.19
WO 2012106495 A1, 2012.08.09
CN 102574815 A, 2012.07.11
CN 105198874 A, 2015.12.30
CN 102548973 A, 2012.07.04
CN 104311554 A, 2015.01.28

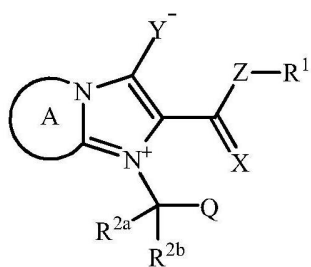
审查员 蒋薇薇

权利要求书5页 说明书59页

(54) 发明名称

介离子杀虫剂

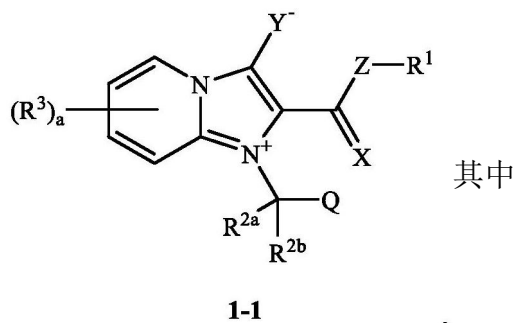
(57) 摘要



(I) 本申请公开

了式1的化合物,包括其所有几何异构体和立体异构体,N-氧化物和盐,其中A、X、Y、Z、R¹、R^{2a}、R^{2b}和Q如本公开所定义的。本申请还公开了包含式1的化合物的组合物,以及用于防治无脊椎害虫的方法,其包括使所述无脊椎害虫或其环境与生物学有效量的本发明的化合物或组合物接触。

1. 化合物, 其具有式1-1的结构, 或其盐,



;

X为O;

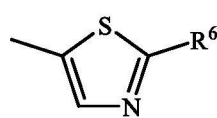
Y为O;

Z为直接键;

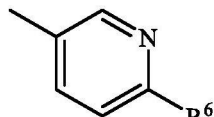
R¹为苯基或吡啶基, 其各自未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代;

R^{2a}和R^{2b}为H;

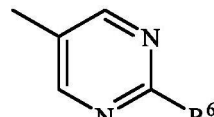
Q为



,



或



;

各个R³独立地为卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、C(=O)OH、C(=O)NH₂、SO₂NH₂、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₂-C₄烯基、C₂-C₄卤代烯基、C₂-C₄炔基、C₃-C₇环烷基、C₃-C₇卤代环烷基、C₄-C₈烷基环烷基、C₄-C₈卤代烷基环烷基、C₄-C₈环烷基烷基、C₄-C₈卤代环烷基烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆卤代烷氧基、C₂-C₆烷氧基羰基、C₂-C₆卤代烷氧基羰基、C₂-C₆烷基羰基或C₂-C₆卤代烷基羰基;

各个R⁴独立地为卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、SF₅、OCN、SCN、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH₂、C(=S)NH₂、SO₂NH₂、C(=O)R¹³、C(=O)OR¹³、NHR¹³、NR¹³R¹⁴、C(=O)NR¹⁶R¹⁴、C(=S)NR¹⁶R¹⁴、SO₂NR¹⁶R¹⁴、OC(=O)R¹⁶、OC(=O)OR¹³、OC(=O)NR¹⁶R¹⁴、N(R¹⁶)C(=O)R¹⁶、N(R¹⁶)C(=O)OR¹⁴、N(R¹⁶)C(=O)NR¹⁶R¹⁷、OSO₂R¹³、OSO₂NR¹⁶R¹⁷、NR¹⁶SO₂R¹³、NR¹⁶SO₂NR¹⁶R¹⁷、Si(R¹³R¹⁴R¹⁵)、C(=NR¹⁶)R¹⁷、C(=NOR¹⁶)R¹⁷、C(=NNR¹⁶R¹⁷)R¹⁸、C(=NN(C(=O)R¹⁴)R¹⁶)R¹⁷、C(=NN(C(=O)OR¹⁴)R¹⁶)R¹⁷、C(=NN(C(=O)NR¹⁶R¹⁷)R¹⁶)R¹⁷、C(=NOR¹⁶)NR¹⁶R¹⁷、ON=CR¹⁶R¹⁷、ONR¹⁶R¹⁷、S(=O)(=NR¹⁶)R¹⁷、SO₂NR¹⁶C(=O)NR¹⁷R¹⁸、P(=X²)R¹³R¹⁴、OP(=X²)R¹³R¹⁴、OP(=X²)(OR¹³)R¹⁴、OP(=X²)(OR¹³)OR¹⁴、N=CR¹⁶R¹⁷、NR¹⁶N=CR¹⁷R¹⁸、NR¹⁶NR¹⁷R¹⁸、NR¹⁶C(=X²)NR¹⁷R¹⁸、NR¹⁶C(=NR¹⁶)NR¹⁷R¹⁸、NR¹⁶NR¹⁶C(=X²)NR¹⁷R¹⁸或NR¹⁶NR¹⁶SO₂NR¹⁷R¹⁸;或者

各个R⁴独立地为C₁-C₈烷基、C₂-C₈烯基、C₂-C₈炔基、C₃-C₁₀环烷基、C₄-C₁₀烷基环烷基、C₄-C₁₀环烷基烷基、C₆-C₁₄环烷基环烷基、C₅-C₁₀烷基环烷基烷基、C₃-C₈环烯基、C₁-C₈烷氧基、C₃-C₈环烷氧基、C₄-C₁₀环烷基烷氧基、C₃-C₁₀环烷氧基烷基、C₃-C₁₀环烷氧基烷氧基、C₂-C₈烯基氧基、C₂-C₈炔基氧基、C₁-C₈烷基硫基、C₁-C₈烷基亚磺酰基、C₁-C₈烷基磺酰基、C₃-C₈环烷基硫基、C₃-C₈环烷基亚磺酰基、C₃-C₈环烷基磺酰基、C₄-C₁₀环烷基烷基硫基、C₄-C₁₀环烷基烷基亚磺酰基、C₄-C₁₀环烷基烷基磺酰基、C₂-C₈烯基硫基、C₂-C₈烯基亚磺酰基、C₂-C₈烯基磺酰基、

C_2-C_8 炔基硫基、 C_2-C_8 炔基亚磺酰基或 C_2-C_8 炔基磺酰基,其各自未被取代或者被至少一个独立地选自 R^{12} 的取代基取代;或者

各个 R^4 独立地为 Z^1Q^1 ;或者

两个 R^4 取代基共同形成5至7元碳环或杂环,各个环含有选自碳原子和至多3个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多3个N,其中至多2个碳原子环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$,并且所述硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_n$,各个环任选地被至多3个独立地选自下列的取代基取代:卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 SO_2NH_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 卤代烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_3-C_7 环烷基、 C_3-C_7 卤代环烷基、 C_4-C_8 烷基环烷基、 C_4-C_8 卤代烷基环烷基、 C_4-C_8 环烷基烷基、 C_4-C_8 卤代环烷基烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 卤代烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基羰基、 C_2-C_6 卤代烷基羰基、 C_1-C_4 烷基硫基、 C_1-C_4 烷基亚磺酰基和 C_1-C_4 烷基磺酰基;

各个 R^5 独立地为卤素、氰基、硝基、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_2-C_3 烯基、 C_2-C_3 卤代烯基、 C_2-C_3 炔基、 $C(=O)OR^8$ 、 $C(=O)NR^9R^{10}$ 或 Z^1Q^2 ;

各个 R^6 独立地为卤素、氰基、硝基、 CHO 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^7$ 、 $C(=O)OR^8$ 、 $C(=O)NR^9R^{10}$ 、 OR^8 、 $S(O)_nR^7$ 、 $SO_2NR^9R^{10}$ 或 $Si(R^7)_3$;或者 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_8 环烷基、 C_4-C_8 烷基环烷基、 C_4-C_8 环烷基烷基、 C_6-C_{10} 环烷基环烷基、 C_5-C_{10} 烷基环烷基烷基、 C_3-C_6 环烯基、 C_2-C_6 烷基羰基或 C_2-C_6 烷氧基羰基,其各自未被取代或者被至少一个独立地选自下列的取代基取代:卤素、氰基、硝基、 CHO 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^7$ 、 $C(=O)OR^8$ 、 $C(=O)NR^9R^{10}$ 、 OR^8 、 $S(O)_nR^7$ 、 $SO_2NR^9R^{10}$ 和 $Si(R^7)_3$;

各个 R^7 、 R^8 、 R^9 和 R^{10} 独立地为 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_8 环烷基、 C_4-C_8 烷基环烷基、 C_4-C_8 环烷基烷基、 C_6-C_{10} 环烷基环烷基、 C_5-C_{10} 烷基环烷基烷基或 C_3-C_6 环烯基,其各自未被取代或者被至少一个独立地选自下列的取代基取代:卤素、氰基、硝基、 CHO 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷基硫基、 C_1-C_4 烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基硫基、 C_1-C_4 卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基、 C_1-C_4 烷基氨基、 C_2-C_8 二烷基氨基、 C_3-C_6 环烷基氨基、 C_2-C_4 烷氧基烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 烷基羰基硫基、 C_2-C_6 烷基氨基羰基、 C_3-C_8 二烷基氨基羰基和 C_3-C_6 三烷基甲硅烷基;或者苯基或5或6元杂芳环,其各自未被取代或者被至少一个独立地选自下列的取代基取代: C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_8 环烷基、 C_4-C_8 烷基环烷基、 C_4-C_8 环烷基烷基、 C_6-C_{10} 环烷基环烷基、 C_5-C_{10} 烷基环烷基烷基、 C_3-C_6 环烯基、卤素、氰基、硝基、 CHO 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷基硫基、 C_1-C_4 烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基硫基、 C_1-C_4 卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基、 C_1-C_4 烷基氨基、 C_2-C_8 二烷基氨基、 C_3-C_6 环烷基氨基、 C_2-C_4 烷氧基烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 烷基羰基硫基、 C_2-C_6 烷基氨基羰基、 C_3-C_8 二烷基氨基羰基和 C_3-C_6 三烷基甲硅烷基;

各个 Z^1 独立地为直接键;或者为含有选自碳原子和至多2个杂原子的链成员的1至4个原子链,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多2个N,其中至多2个碳原子链成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$,并且所述硫原子链成员独立地选自 $S(=O)_n$,各个1至4个原子链未被取代或者被至多4个独立地选自 R^5 的取代基取代,或者当 R^5 为卤素时,被至多9个卤素取代;

各个 X^2 独立地为O或S;

各个 Q^1 独立地为3至10元环或7至11元环系,各个环或环系含有选自碳原子和至多4个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多4个N,其中至多3个碳原子环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$,并且所述硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_u(=NR^{19})_z$,各个环或环系任选地被至多4个独立地选自下列的取代基取代:卤素、氰基、硝基、 CHO 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^7$ 、 $C(=O)OR^8$ 、 $C(=O)NR^9R^{10}$ 、 OR^8 、 $S(O)_nR^7$ 、 $SO_2NR^9R^{10}$ 、 $Si(R^7)_3$ 和 R^{11} ;

各个 Q^2 独立地为苯基或5或6元杂芳环,其各自未被取代或者被至多3个独立地选自下列的取代基取代:卤素、氰基、硝基、 CHO 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^7$ 、 $C(=O)OR^8$ 、 $C(=O)NR^9R^{10}$ 、 OR^8 、 $S(O)_nR^7$ 、 $SO_2NR^9R^{10}$ 、 $Si(R^7)_3$ 和 R^{11} ;

各个 R^{11} 独立地为 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_8 环烷基、 C_4 - C_8 烷基环烷基、 C_4 - C_8 环烷基烷基、 C_6 - C_{10} 环烷基环烷基、 C_5 - C_{10} 烷基环烷基烷基或 C_3 - C_6 环烯基,其各自未被取代或者被至少一个独立地选自下列的取代基取代:卤素、氰基、硝基、 CHO 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 烷基硫基、 C_1 - C_4 烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 烷基磺酰基、 C_1 - C_4 卤代烷基硫基、 C_1 - C_4 卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 卤代烷基磺酰基、 C_1 - C_4 烷基氨基、 C_2 - C_8 二烷基氨基、 C_3 - C_6 环烷基氨基、 C_2 - C_4 烷氧基烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_6 烷氧基羰基、 C_2 - C_6 烷基羰基氧基、 C_2 - C_6 烷基羰基硫基、 C_2 - C_6 烷基氨基羰基、 C_3 - C_8 二烷基氨基羰基和 C_3 - C_6 三烷基甲硅烷基;或者苯基或5或6元杂芳环,其各自未被取代或者被至少一个独立地选自下列的取代基取代: C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_8 环烷基、 C_4 - C_8 烷基环烷基、 C_4 - C_8 环烷基烷基、 C_6 - C_{10} 环烷基环烷基、 C_5 - C_{10} 烷基环烷基烷基、 C_3 - C_6 环烯基、卤素、氰基、硝基、 CHO 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 烷基硫基、 C_1 - C_4 烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 烷基磺酰基、 C_1 - C_4 卤代烷基硫基、 C_1 - C_4 卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 卤代烷基磺酰基、 C_1 - C_4 烷基氨基、 C_2 - C_8 二烷基氨基、 C_3 - C_6 环烷基氨基、 C_2 - C_4 烷氧基烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_6 烷氧基羰基、 C_2 - C_6 烷基羰基氧基、 C_2 - C_6 烷基羰基硫基、 C_2 - C_6 烷基氨基羰基、 C_3 - C_8 二烷基氨基羰基和 C_3 - C_6 三烷基甲硅烷基;

各个 R^{12} 独立地为卤素、氰基、硝基、 CHO 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^7$ 、 $C(=O)OR^8$ 、 $C(=O)NR^9R^{10}$ 、 OR^8 、 $S(O)_nR^7$ 、 $SO_2NR^9R^{10}$ 、 $Si(R^7)_3$ 或 Z^1Q^2 ;

各个 R^{13} 、 R^{14} 和 R^{15} 独立地为 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_8 环烷基、 C_4 - C_8 烷基环烷基、 C_4 - C_8 环烷基烷基、 C_6 - C_{10} 环烷基环烷基、 C_5 - C_{10} 烷基环烷基烷基或 C_3 - C_6 环烯基,其各自未被取代或者被至少一个独立地选自 R^{12} 的取代基取代;或者为 Q^2 ;

各个 R^{16} 、 R^{17} 和 R^{18} 独立地为H、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_8 环烷基、 C_4 - C_8 烷基环烷基、 C_4 - C_8 环烷基烷基、 C_6 - C_{10} 环烷基环烷基、 C_5 - C_{10} 烷基环烷基烷基或 C_3 - C_6 环烯基,其各自未被取代或者被至少一个独立地选自 R^{12} 的取代基取代;或者为 Q^2 ;

各个 R^{19} 独立地为H、氰基、 OCN 、 SCN 、 CHO 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=S)NH_2$ 、 SO_2NH_2 、 $C(=O)R^{13}$ 、 $C(=O)OR^{13}$ 、 NHR^{13} 、 $NR^{13}R^{14}$ 、 $C(=O)NR^{16}R^{14}$ 、 $C(=S)NR^{16}R^{14}$ 、 $SO_2NR^{16}R^{14}$ 、 $OC(=O)R^{16}$ 、 $OC(=O)OR^{13}$ 、 $OC(=O)NR^{16}R^{14}$ 、 $N(R^{16})C(=O)R^{16}$ 、 $N(R^{16})C(=O)OR^{14}$ 、 $N(R^{16})C(=O)NR^{16}R^{17}$ 、 OSO_2R^{13} 、 $OSO_2NR^{16}R^{17}$ 、 $NR^{16}SO_2R^{13}$ 、 $NR^{16}SO_2NR^{16}R^{17}$ 、 $Si(R^{13}R^{14}R^{15})$ 或 Z^1Q^2 ;或者 C_1 - C_8 烷基、 C_2 - C_8 烯基、 C_2 - C_8 炔基、 C_3 - C_{10} 环烷基、 C_4 - C_{10} 烷基环烷基、 C_4 - C_{10} 环烷基烷基、 C_6 - C_{14} 环烷基环烷基、 C_5 - C_{10} 烷基环烷基烷基、 C_3 - C_8 环烯基、 C_1 - C_8 烷氧基、 C_3 - C_8 环烷氧基、 C_4 - C_{10} 环烷基烷氧基、 C_2 - C_8

烯基氧基、C₂-C₈炔基氧基、C₁-C₈烷基硫基、C₁-C₈烷基亚磺酰基、C₁-C₈烷基磺酰基、C₃-C₈环烷基硫基、C₃-C₈环烷基亚磺酰基、C₃-C₈环烷基磺酰基、C₄-C₁₀环烷基烷基硫基、C₄-C₁₀环烷基烷基亚磺酰基、C₄-C₁₀环烷基烷基磺酰基、C₂-C₈烯基硫基、C₂-C₈烯基亚磺酰基、C₂-C₈烯基磺酰基、C₂-C₈炔基硫基、C₂-C₈炔基亚磺酰基或C₂-C₈炔基磺酰基,其各自未被取代或者被至少一个独立地选自R¹²的取代基取代;

各个n独立地为0、1或2;

u和z在S(=O)_u(=NR¹⁹)_z的各个实例中独立地为0、1或2,条件是u与z的和在S(=O)_u(=NR¹⁹)_z的各个实例中为0、1或2,并且

a为0、1、2或3。

2. 权利要求1的化合物,其中

R¹为苯基,其未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代;

R³为F、Cl或CH₃;

a为0或1;并且

R⁶为H、F、Cl、Br、CH₃、CHF₂或CF₃。

3. 组合物,其包含权利要求1或权利要求2的化合物和至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的附加组分,所述组合物任选地还包含至少一种附加的生物学活性化合物或药剂。

4. 权利要求3的组合物,其中所述至少一种附加的生物学活性化合物或药剂选自:阿巴美丁、高灭磷、灭螨醌、啉虫脒、氟丙菊酯、啉喃环丙虫酯、磺胺螨酯、双甲脒、阿维菌素、印楝素、谷硫磷、丙硫克百威、杀虫磺、联苯菊酯、联苯肼酯、双三氟虫脒、硼酸盐、噻嗪酮、西维因、卡巴呋喃、杀螟丹、伐虫脒、氯虫苯甲酰胺、溴虫脒、定虫隆、毒死蜱、甲基毒死蜱、环虫酰胺、螨死净、噻虫胺、氰虫酰胺、环溴虫酰胺、乙氰菊酯、环氧虫啉、丁氟螨酯、氟氯氰菊酯、β-氟氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯、γ-三氟氯氰菊酯、λ-三氟氯氰菊酯、氯氰菊酯、α-氯氰菊酯、ζ-氯氰菊酯、灭蝇胺、溴氰菊酯、丁醚脒、二嗪农、狄氏剂、二氟脒、四氟甲醚菊酯、杀虫双、乐果、呋虫胺、苯虫醚、埃玛菌素、硫丹、高氰戊菊酯、乙虫脒、依芬普司、乙螨唑、苯丁锡、杀螟硫磷、苯硫威、苯氧威、甲氰菊酯、氰戊菊酯、氟虫脒、flometoquin、氟啉虫酰胺、氟虫酰胺、氟氰戊菊酯、啉虫胺、氟虫脒、氟菌螨酯、氟噻虫砒、氟吡菌酰胺、flupiprole、氟吡呋喃酮、氟胺氰菊酯、τ-氟胺氰菊酯、地虫硫磷、噻唑磷、氯虫酰胺、heptafluthrin、氟铃脒、噻螨酮、氟蚁腓、吡虫啉、茚虫威、杀虫皂、异柳磷、虱螨脒、马拉硫磷、氯氟醚菊酯、氰氟虫腓、蜗牛敌、甲胺磷、杀扑磷、甲硫双威、灭多虫、甲氧普林、甲氧滴滴涕、甲氧苄氟菊酯、久效磷、monofluthrin、甲氧虫酰胺、烯啉虫胺、硝乙脒噻唑、双苯氟脒、多氟脒、草氨酰、对硫磷、甲基对硫磷、扑灭司林、甲拌磷、伏杀硫磷、亚胺硫磷、磷胺、抗蚜威、丙溴磷、丙氟菊酯、克螨特、丙苯炔菊酯、pyflubumide、吡蚜酮、吡啉氟虫脒、除虫菊酯、啉螨灵、啉虫丙醚、新啉啉啉(间二氮杂苯)类杀虫剂、啉螨胺、吡啉氟虫脒、蚊蝇醚、鱼藤酮、利阿诺定、氟硅菊酯、乙基多杀菌素、多杀菌素、螺螨酯、螺甲螨酯、螺虫乙酯、硫丙磷、砒虫啉、虫酰胺、吡螨胺、伏虫脒、七氟菊酯、特丁磷、杀虫畏、似虫菊、四氟醚菊酯、噻虫啉、噻虫嗪、硫双威、啉虫酰胺、四溴菊酯、啉蚜威、敌百虫、杀铃脒、苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*)的所有菌株、昆虫病原细菌、核型多角体(Nucleo polyhedrosis)病毒的所有毒株、昆虫病原病毒以及昆虫病原真菌。

5. 权利要求4的组合物,其中所述至少一种附加的生物学活性化合物或药剂选自:阿巴美丁、啉虫脒、氟丙菊酯、啉喃环丙虫酯、双甲脒、阿维菌素、印楝素、丙硫克百威、杀虫磺、联苯菊酯、3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-[(甲基氨基)羰基]苯基]-1H-吡啶-5-甲酰胺、噻嗪酮、西维因、杀螟丹、氯虫苯甲酰胺、溴虫腈、毒死蜱、噻虫胺、氰虫酰胺、环溴虫酰胺、乙氰菊酯、氟氯氰菊酯、 β -氟氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯、 λ -三氟氯氰菊酯、 γ -三氟氯氰菊酯、氯氰菊酯、 α -氯氰菊酯、 ζ -氯氰菊酯、灭蝇胺、溴氰菊酯、狄氏剂、呋虫胺、苯虫醚、埃玛菌素、硫丹、高氰戊菊酯、乙虫腈、依芬普司、乙螨唑、杀螟硫磷、苯硫威、苯氧威、氰戊菊酯、氟虫腈、flometoquin、氟啉虫酰胺、氟虫酰胺、氟虫脲、氟菌螨酯、氟噻虫砒、flupiprole、氟吡呋喃酮、氟胺氰菊酯、伐虫脒、噻唑磷、heptafluthrin、氟铃脲、氟蚁腓、吡虫啉、茚虫威、虱螨脲、氯氟醚菊酯、氰氟虫腓、甲硫双威、灭多虫、甲氧普林、甲氧虫酰肼、甲氧苄氟菊酯、monofluthrin、烯啉虫胺、硝乙脲噻唑、双苯氟脲、草氨酰、pyflubumide、吡蚜酮、除虫菊酯、哒螨灵、啉虫丙醚、噻螨胺、蚊蝇醚、利阿诺定、乙基多杀菌素、多杀菌素、螺螨酯、螺甲螨酯、螺虫乙酯、砒虫啉、虫酰肼、似虫菊、噻虫啉、噻虫嗪、硫双威、杀虫双、四溴菊酯、四氟醚菊酯、啉蚜威、杀铃脲、苏云金芽孢杆菌的所有菌株以及核型多角体病毒的所有毒株。

6. 非治疗目的的、用于防治无脊椎害虫的方法,其包括使所述无脊椎害虫或其环境与生物学有效量的权利要求1或权利要求2的化合物接触。

7. 处理种子的方法,其包括用权利要求1或权利要求2的化合物处理种子,其中经处理的种子包含按处理前该种子的重量计0.0001%至1%的量的所述化合物。

介离子杀虫剂

发明领域

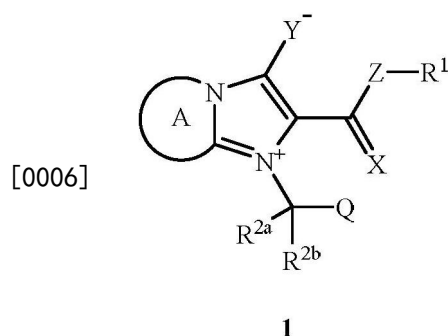
[0001] 本发明涉及适用于农学和非农学用途的某些介离子化合物、其N-氧化物、盐和组合物,以及其用于在农学和非农学环境中防治无脊椎害虫如节肢动物的方法。

[0002] 发明背景

[0003] 防治无脊椎害虫在实现高作物效率中是极其重要的。无脊椎害虫对生长和储存的农作物的损害可引起生产力的显著降低,并由此导致消费者的成本增加。对林业、温室作物、观赏植物、苗圃作物、储存食品和纤维产品、家畜、家庭、草皮、木质产品以及公共和动物健康中的无脊椎害虫的防治也是重要的。为了这些目的,许多产品是可商购的,但持续需要更有效、较低成本、较低毒性、对环境更安全或具有不同的作用位点的新型化合物。

[0004] 发明概述

[0005] 本发明涉及式1的化合物(包括所有几何异构体和立体异构体)、其N-氧化物和盐,以及包含它们的组合物,以及它们用于防治无脊椎害虫的用途:



[0007] 其中

[0008] X为O或S;

[0009] Y为O或S;

[0010] A为含有选自碳原子和至多3个杂原子的环成员的5、6或7元环,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多3个N,其中至多2个碳原子环成员独立地选自C(=O)和C(=S),并且所述硫原子环成员独立地选自S(=O)_n,各个环未被取代或者被至多3个独立地选自R³的取代基取代;

[0011] Z为直接键;或者为含有选自碳原子和至多2个杂原子的链成员的1至4个原子链,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多2个N,其中至多2个碳原子链成员独立地选自C(=O)和C(=S),并且所述硫原子链成员独立地选自S(=O)_n,各个1至4个原子链未被取代或者被至多4个独立地选自R⁵的取代基取代,或者当R⁵为卤素时,被至多9个卤素取代;

[0012] R¹为H或卤素;3至10元环或7至11元环系,各个环或环系含有选自碳原子和至多4个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多4个N,其中至多3个碳原子环成员独立地选自C(=O)和C(=S),并且所述硫原子环成员独立地选自S(=O)_u(=NR¹⁹)_z,各个环或环系未被取代或者被至多8个独立地选自R⁴的取代基取代;条件是当Z为直接键时,R¹不是H或卤素;

[0013] R^{2a}和R^{2b}独立地为H、卤素、氰基、C₁-C₃烷基、C₂-C₃烯基或C₂-C₃炔基;或者R^{2a}和R^{2b}共

同形成含有选自碳原子和至多一个杂原子的环成员的3至6元环,所述杂原子选自O、N和S(O)_n;

[0014] Q为5或6元杂芳环,其未被取代或者被至多3个独立地选自R⁶的取代基取代;

[0015] 各个R³独立地为卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、C(=O)OH、C(=O)NH₂、SO₂NH₂、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₂-C₄烯基、C₂-C₄卤代烯基、C₂-C₄炔基、C₃-C₇环烷基、C₃-C₇卤代环烷基、C₄-C₈烷基环烷基、C₄-C₈卤代烷基环烷基、C₄-C₈环烷基烷基、C₄-C₈卤代环烷基烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆卤代烷氧基、C₂-C₆烷氧基羰基、C₂-C₆卤代烷氧基羰基、C₂-C₆烷基羰基或C₂-C₆卤代烷基羰基;

[0016] 各个R⁴独立地为卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、SF₅、OCN、SCN、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH₂、C(=S)NH₂、SO₂NH₂、C(=O)R¹³、C(=O)OR¹³、NHR¹³、NR¹³R¹⁴、C(=O)NR¹⁶R¹⁴、C(=S)NR¹⁶R¹⁴、SO₂NR¹⁶R¹⁴、OC(=O)R¹⁶、OC(=O)OR¹³、OC(=O)NR¹⁶R¹⁴、N(R¹⁶)C(=O)R¹⁶、N(R¹⁶)C(=O)OR¹⁴、N(R¹⁶)C(=O)NR¹⁶R¹⁷、OSO₂R¹³、OSO₂NR¹⁶R¹⁷、NR¹⁶SO₂R¹³、NR¹⁶SO₂NR¹⁶R¹⁷、Si(R¹³R¹⁴R¹⁵)、C(=NR¹⁶)R¹⁷、C(=NOR¹⁶)R¹⁷、C(=NNR¹⁶R¹⁷)R¹⁸、C(=NN(C(=O)R¹⁴)R¹⁶)R¹⁷、C(=NN(C(=O)OR¹⁴)R¹⁶)R¹⁷、C(=NN(C(=O)NR¹⁶R¹⁷)R¹⁶)R¹⁷、C(=NOR¹⁶)NR¹⁶R¹⁷、ON=CR¹⁶R¹⁷、ONR¹⁶R¹⁷、S(=O)(=NR¹⁶)R¹⁷、SO₂NR¹⁶C(=O)NR¹⁷R¹⁸、P(=X²)R¹³R¹⁴、OP(=X²)R¹³R¹⁴、OP(=X²)(OR¹³)R¹⁴、OP(=X²)(OR¹³)OR¹⁴、N=CR¹⁶R¹⁷、NR¹⁶N=CR¹⁷R¹⁸、NR¹⁶NR¹⁷R¹⁸、NR¹⁶C(=X²)NR¹⁷R¹⁸、NR¹⁶C(=NR¹⁶)NR¹⁷R¹⁸、NR¹⁶NR¹⁶C(=X²)NR¹⁷R¹⁸或NR¹⁶NR¹⁶SO₂NR¹⁷R¹⁸;或者

[0017] 各个R⁴独立地为C₁-C₈烷基、C₂-C₈烯基、C₂-C₈炔基、C₃-C₁₀环烷基、C₄-C₁₀烷基环烷基、C₄-C₁₀环烷基烷基、C₆-C₁₄环烷基环烷基、C₅-C₁₀烷基环烷基烷基、C₃-C₈环烯基、C₁-C₈烷氧基、C₃-C₈环烷氧基、C₄-C₁₀环烷基烷氧基、C₃-C₁₀环烷氧基烷基、C₃-C₁₀环烷氧基烷氧基、C₂-C₈烯基氧基、C₂-C₈炔基氧基、C₁-C₈烷基硫基、C₁-C₈烷基亚磺酰基、C₁-C₈烷基磺酰基、C₃-C₈环烷基硫基、C₃-C₈环烷基亚磺酰基、C₃-C₈环烷基磺酰基、C₄-C₁₀环烷基烷基硫基、C₄-C₁₀环烷基烷基亚磺酰基、C₄-C₁₀环烷基烷基磺酰基、C₂-C₈烯基硫基、C₂-C₈烯基亚磺酰基、C₂-C₈烯基磺酰基、C₂-C₈炔基硫基、C₂-C₈炔基亚磺酰基或C₂-C₈炔基磺酰基,其各自未被取代或者被至少一个独立地选自R¹²的取代基取代;或者

[0018] 各个R⁴独立地为Z¹Q¹;或者

[0019] 两个R⁴取代基共同形成5至7元碳环或杂环,各个环含有选自碳原子和至多3个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多3个N,其中至多2个碳原子环成员独立地选自C(=O)和C(=S),并且所述硫原子环成员独立地选自S(=O)_n,各个环任选地被至多3个独立地选自下列的取代基取代:卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、C(=O)OH、C(=O)NH₂、SO₂NH₂、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₂-C₄烯基、C₂-C₄卤代烯基、C₂-C₄炔基、C₃-C₇环烷基、C₃-C₇卤代环烷基、C₄-C₈烷基环烷基、C₄-C₈卤代烷基环烷基、C₄-C₈环烷基烷基、C₄-C₈卤代环烷基烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆卤代烷氧基、C₂-C₆烷氧基羰基、C₂-C₆卤代烷氧基羰基、C₂-C₆烷基羰基、C₂-C₆卤代烷基羰基、C₁-C₄烷基硫基、C₁-C₄烷基亚磺酰基和C₁-C₄烷基磺酰基;

[0020] 各个R⁵独立地为卤素、氰基、硝基、C₁-C₃烷基、C₁-C₃卤代烷基、C₂-C₃烯基、C₂-C₃卤代烯基、C₂-C₃炔基、C(=O)OR⁸、C(=O)NR⁹R¹⁰或Z¹Q²;

[0021] 各个R⁶独立地为卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH₂、C(=O)R⁷、C(=O)OR⁸、C(=O)NR⁹R¹⁰、OR⁸、S(O)_nR⁷、SO₂NR⁹R¹⁰或Si(R⁷)₃;或者C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₈环烷基、C₄-C₈烷基环烷基、C₄-C₈环烷基烷基、C₆-C₁₀环烷基环烷基、C₅-C₁₀烷基环烷基烷

基、 C_3-C_6 环烯基、 C_2-C_6 烷基羰基或 C_2-C_6 烷氧基羰基,其各自未被取代或者被至少一个独立地选自下列的取代基取代:卤素、氰基、硝基、 CHO 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^7$ 、 $C(=O)OR^8$ 、 $C(=O)NR^9R^{10}$ 、 OR^8 、 $S(O)_nR^7$ 、 $SO_2NR^9R^{10}$ 和 $Si(R^7)_3$;

[0022] 各个 R^7 、 R^8 、 R^9 和 R^{10} 独立地为 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_8 环烷基、 C_4-C_8 烷基环烷基、 C_4-C_8 环烷基烷基、 C_6-C_{10} 环烷基环烷基、 C_5-C_{10} 烷基环烷基烷基或 C_3-C_6 环烯基,其各自未被取代或者被至少一个独立地选自下列的取代基取代:卤素、氰基、硝基、 CHO 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷基硫基、 C_1-C_4 烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基硫基、 C_1-C_4 卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基、 C_1-C_4 烷基氨基、 C_2-C_8 二烷基氨基、 C_3-C_6 环烷基氨基、 C_2-C_4 烷氧基烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 烷基羰基硫基、 C_2-C_6 烷基氨基羰基、 C_3-C_8 二烷基氨基羰基和 C_3-C_6 三烷基甲硅烷基;或者苯基或5或6元杂芳环,其各自未被取代或者被至少一个独立地选自下列的取代基取代: C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_8 环烷基、 C_4-C_8 烷基环烷基、 C_4-C_8 环烷基烷基、 C_6-C_{10} 环烷基环烷基、 C_5-C_{10} 烷基环烷基烷基、 C_3-C_6 环烯基、卤素、氰基、硝基、 CHO 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷基硫基、 C_1-C_4 烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基硫基、 C_1-C_4 卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基、 C_1-C_4 烷基氨基、 C_2-C_8 二烷基氨基、 C_3-C_6 环烷基氨基、 C_2-C_4 烷氧基烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 烷基羰基硫基、 C_2-C_6 烷基氨基羰基、 C_3-C_8 二烷基氨基羰基和 C_3-C_6 三烷基甲硅烷基;

[0023] 各个 Z^1 独立地为直接键;或者为含有选自碳原子和至多2个杂原子的链成员的1至4个原子链,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多2个N,其中至多2个碳原子链成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$,并且所述硫原子链成员独立地选自 $S(=O)_n$,各个1至4个原子链未被取代或者被至多4个独立地选自 R^5 的取代基取代,或者当 R^5 为卤素时,被至多9个卤素取代;

[0024] 各个 X^2 独立地为O或S;

[0025] 各个 Q^1 独立地为3至10元环或7至11元环系,各个环或环系含有选自碳原子和至多4个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多4个N,其中至多3个碳原子环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$,并且所述硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_u(=NR^{19})_z$,各个环或环系任选地被至多4个独立地选自下列的取代基取代:卤素、氰基、硝基、 CHO 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^7$ 、 $C(=O)OR^8$ 、 $C(=O)NR^9R^{10}$ 、 OR^8 、 $S(O)_nR^7$ 、 $SO_2NR^9R^{10}$ 、 $Si(R^7)_3$ 和 R^{11} ;

[0026] 各个 Q^2 独立地为苯基或5或6元杂芳环,其各自未被取代或者被至多3个独立地选自下列的取代基取代:卤素、氰基、硝基、 CHO 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)R^7$ 、 $C(=O)OR^8$ 、 $C(=O)NR^9R^{10}$ 、 OR^8 、 $S(O)_nR^7$ 、 $SO_2NR^9R^{10}$ 、 $Si(R^7)_3$ 和 R^{11} ;

[0027] 各个 R^{11} 独立地为 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_8 环烷基、 C_4-C_8 烷基环烷基、 C_4-C_8 环烷基烷基、 C_6-C_{10} 环烷基环烷基、 C_5-C_{10} 烷基环烷基烷基或 C_3-C_6 环烯基,其各自未被取代或者被至少一个独立地选自下列的取代基取代:卤素、氰基、硝基、 CHO 、 $C(=O)OH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷基硫基、 C_1-C_4 烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基硫基、 C_1-C_4 卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基、 C_1-C_4 烷基氨基、 C_2-C_8 二烷基氨基、 C_3-C_6 环烷基氨基、 C_2-C_4 烷氧基烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 烷基羰基硫基、 C_2-C_6 烷基氨基羰基、 C_3-C_8 二烷基氨基羰基和 C_3-C_6 三烷基甲硅烷基;

烷基羰基氧基、C₂-C₆烷基羰基硫基、C₂-C₆烷基氨基羰基、C₃-C₈二烷基氨基羰基和C₃-C₆三烷基甲硅烷基；或者苯基或5或6元杂芳环，其各自未被取代或者被至少一个独立地选自下列的取代基取代：C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₈环烷基、C₄-C₈烷基环烷基、C₄-C₈环烷基烷基、C₆-C₁₀环烷基环烷基、C₅-C₁₀烷基环烷基烷基、C₃-C₆环烯基、卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH₂、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄卤代烷氧基、C₁-C₄烷基硫基、C₁-C₄烷基亚磺酰基、C₁-C₄烷基磺酰基、C₁-C₄卤代烷基硫基、C₁-C₄卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄卤代烷基磺酰基、C₁-C₄烷基氨基、C₂-C₈二烷基氨基、C₃-C₆环烷基氨基、C₂-C₄烷氧基烷基、C₂-C₄烷基羰基、C₂-C₆烷氧基羰基、C₂-C₆烷基羰基氧基、C₂-C₆烷基羰基硫基、C₂-C₆烷基氨基羰基、C₃-C₈二烷基氨基羰基和C₃-C₆三烷基甲硅烷基；

[0028] 各个R¹²独立地为卤素、氰基、硝基、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH₂、C(=O)R⁷、C(=O)OR⁸、C(=O)NR⁹R¹⁰、OR⁸、S(O)_nR⁷、SO₂NR⁹R¹⁰、Si(R⁷)₃或Z¹Q²；

[0029] 各个R¹³、R¹⁴和R¹⁵独立地为C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₈环烷基、C₄-C₈烷基环烷基、C₄-C₈环烷基烷基、C₆-C₁₀环烷基环烷基、C₅-C₁₀烷基环烷基烷基或C₃-C₆环烯基，其各自未被取代或者被至少一个独立地选自R¹²的取代基取代；或者为Q²；

[0030] 各个R¹⁶、R¹⁷和R¹⁸独立地为H、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₈环烷基、C₄-C₈烷基环烷基、C₄-C₈环烷基烷基、C₆-C₁₀环烷基环烷基、C₅-C₁₀烷基环烷基烷基或C₃-C₆环烯基，其各自未被取代或者被至少一个独立地选自R¹²的取代基取代；或者为Q²；

[0031] 各个R¹⁹独立地为H、氰基、OCN、SCN、CHO、C(=O)OH、C(=O)NH₂、C(=S)NH₂、SO₂NH₂、C(=O)R¹³、C(=O)OR¹³、NHR¹³、NR¹³R¹⁴¹⁴、C(=O)NR¹⁶R¹⁴、C(=S)NR¹⁶R¹⁴、SO₂NR¹⁶R¹⁴、OC(=O)R¹⁶、OC(=O)OR¹³、OC(=O)NR¹⁶R¹⁴、N(R¹⁶)C(=O)R¹⁶、N(R¹⁶)C(=O)OR¹⁴、N(R¹⁶)C(=O)NR¹⁶R¹⁷、OSO₂R¹³、OSO₂NR¹⁶R¹⁷、NR¹⁶SO₂R¹³、NR¹⁶SO₂NR¹⁶R¹⁷、Si(R¹³R¹⁴R¹⁵)或Z¹Q²；或者C₁-C₈烷基、C₂-C₈烯基、C₂-C₈炔基、C₃-C₁₀环烷基、C₄-C₁₀烷基环烷基、C₄-C₁₀环烷基烷基、C₆-C₁₄环烷基环烷基、C₅-C₁₀烷基环烷基烷基、C₃-C₈环烯基、C₁-C₈烷氧基、C₃-C₈环烷氧基、C₄-C₁₀环烷基烷氧基、C₂-C₈烯基氧基、C₂-C₈炔基氧基、C₁-C₈烷基硫基、C₁-C₈烷基亚磺酰基、C₁-C₈烷基磺酰基、C₃-C₈环烷基硫基、C₃-C₈环烷基亚磺酰基、C₃-C₈环烷基磺酰基、C₄-C₁₀环烷基烷基硫基、C₄-C₁₀环烷基烷基亚磺酰基、C₄-C₁₀环烷基烷基磺酰基、C₂-C₈烯基硫基、C₂-C₈烯基亚磺酰基、C₂-C₈烯基磺酰基、C₂-C₈炔基硫基、C₂-C₈炔基亚磺酰基或C₂-C₈炔基磺酰基，其各自未被取代或者被至少一个独立地选自R¹²的取代基取代；

[0032] 各个n独立地为0、1或2；并且

[0033] u和z在S(=O)_u(=NR¹⁹)_z的各个实例中独立地为0、1或2，条件是u与z的和在S(=O)_u(=NR¹⁹)Z的各个实例中为0、1或2。

[0034] 本发明还提供组合物，其包含式1的化合物、其N-氧化物或盐，以及至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的附加组分。在一个实施方案中，本发明还提供用于防治无脊椎害虫的组合物，其包含式1的化合物、其N-氧化物或盐，以及至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的附加组分，所述组合物任选地还包含至少一种附加的生物学活性化合物或药剂。

[0035] 本发明提供用于防治无脊椎害虫的方法，其包括使所述无脊椎害虫或其环境与生物学有效量的式1的化合物、其N-氧化物或盐（例如，以本文所述的组合物的形式）接触。本发明还涉及这样的方法，其中使所述无脊椎害虫或其环境与包含生物学有效量的式1的化

合物、其N-氧化物或盐,以及至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的附加组分的组合物接触,所述组合物任选地还包含生物学有效量的至少一种附加的生物学活性化合物或药剂。

[0036] 本发明还提供用于保护种子免受无脊椎害虫的方法,其包括使该种子与生物学有效量的式1的化合物、其N-氧化物或盐(例如,以本文所述的组合物的形式)接触。本发明还涉及经处理的种子。本发明还提供用于保护动物免受无脊椎寄生害虫的方法,其包括向所述动物给药杀寄生虫有效量的式1的化合物、其N-氧化物或盐(例如,以本文所述的组合物的形式)。本发明还提供式1的化合物、其N-氧化物或盐(例如,以本文所述的组合物的形式)在保护动物免受无脊椎害虫中的用途。

[0037] 本发明还提供提高农作物活力的方法,其包括使所述农作物、生长所述农作物的种子或所述农作物的所在地(如生长介质)与生物学有效量的式1的化合物(例如,以本文所述的组合物的形式)接触。

[0038] 发明详述

[0039] 如本文所用,术语“包含(comprises,comprising)”、“包括(includes,including)”、“具有(has,having)”、“含有(contains,containing)”、“特征在于”或其任何其他变型旨在覆盖非排他性的包括,以任何明确指明的限定为条件。例如,包含一系列元素的组合物、混合物、工艺或方法不必仅限于那些元素,而是可以包括其他未明确列出的元素,或这样的组合物、混合物、工艺或方法固有的元素。

[0040] 连接短语“由…组成”排除任何未指出的元素、步骤或成分。如果在权利要求中,则这样的短语会使权利要求为封闭式,使其不包含除那些描述的材料以外的材料,但通常与其相关的杂质除外。当短语“由…组成”出现在权利要求的主体的子句中,而非紧接前序部分时,其仅限制在该子句中提到的元素;其他元素不作为整体从权利要求中被排除。

[0041] 连接短语“基本上由…组成”用于限定除了字面披露的那些以外还包括材料、步骤、特征、组分或元素的组合物或方法,条件是这些附加的材料、步骤、特征、组分或元素不会实质影响请求保护的发明的基本和新颖特征。术语“基本上由…组成”居于“包含”和“由…组成”中间。

[0042] 当申请人已经用开放式术语如“包含”定义了发明或其一部分时,则应易于理解(除非另外指明),说明书应被解释为还使用术语“基本上由…组成”或“由…组成”描述这样的发明。

[0043] 此外,除非有相反的明确说明,“或”是指包含性的“或”,而不是指排他性的“或”。例如,条件A或B由下列任一项满足:A是真(或存在)和B是假(或不存在),A是假(或不存在)和B是真(或存在),和A和B二者都是真(或存在)。

[0044] 同样,在本发明的元素或组分前的不定冠词“一个/一种(a/an)”关于元素或组分的例子(即,出现)的数目旨在是非限制性的。因此,“一个/一种”应理解为包括一个/一种或至少一个/一种,并且元素或组分的单数词语形式还包括复数,除非该数值明显意指单数。

[0045] 如本公开所提及,术语“无脊椎害虫”包括作为害虫具有经济重要性的节肢动物、腹足动物、线虫和蠕虫。术语“节肢动物”包括昆虫、螨虫、蜘蛛、蝎子、蜈蚣、千足虫、球潮虫和综合纲(symphytan)。术语“腹足动物”包括蜗牛、蛞蝓和其他柄眼亚目。术语“线虫”包括线虫动物门的成员,例如植食性的线虫和寄生于动物的蠕虫线虫。术语“蠕虫”包括所有的

寄生虫,如蛔虫(线虫动物门)、犬恶丝虫(线虫动物门,胞管肾纲类)、吸虫(扁形动物门,吸虫纲)、棘头虫(棘头动物门)和绦虫(扁形动物门,绦虫纲)。

[0046] 在本公开的上下文中,“无脊椎害虫防治”是指抑制无脊椎害虫发育(包括死亡率、取食减少和/或交配干扰),并且相关的表达以类似方式定义。

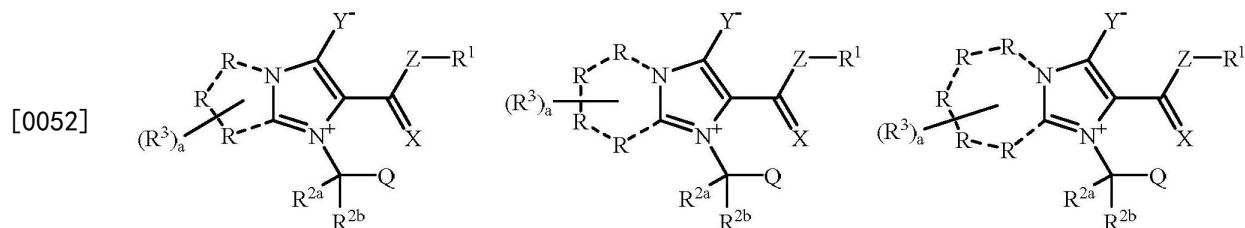
[0047] 术语“农学”是指大田作物的生产,例如用于食物和纤维,并且包括玉蜀黍或玉米、大豆和其他豆类、稻、谷类(例如,小麦、燕麦、大麦、黑麦和稻)、叶类蔬菜(例如,莴苣、卷心菜和其他甘蓝类作物)、水果蔬菜(例如,西红柿、胡椒、茄子、十字花科植物和葫芦)、马铃薯、甘薯、葡萄、棉花、木本果(例如,梨果、核果(stone)和柑橘)、小果(例如,浆果和樱桃)和其他特种作物(例如,低芥酸菜籽、向日葵和橄榄)的生长。

[0048] 术语“非农学”是指不同于大田作物,如园艺作物(例如,不在田地生长的温室、苗圃或观赏植物)、住宅、农业、商业和工业结构,草皮(例如,草场、牧场、高尔夫球场、草坪、运动场等)、木制产品、储存产品、农业林业和植被管理、公共卫生(即人类)和动物健康(例如,驯养动物如宠物、家畜和家禽,非驯养动物如野生动物)应用。

[0049] 术语“作物活力”是指作物植物的生长速率或生物质积累。“活力的增加”是指作物植物相对于未处理的对照作物植物在生长或生物质积累上的增加。术语“作物产率”是指收获作物植物后获得的作物材料的在数量和质量二者上的回报。“作物产率的增加”是指相对于未处理的对照作物植物的作物产率增加。

[0050] 术语“生物学有效量”是指当施用于(即接触)待防治的无脊椎害虫或其环境,或植物、生长植物的种子或植物的所在地(例如,生长介质)以保护植物免受无脊椎害虫的伤害或为了其他所期望的效果(例如,增加植物活力)时足以产生所期望生物效应的生物学活性化合物(例如,式1的化合物)的量。

[0051] 在式1的结构中,变量A被定义为含有选自碳原子和至多3个杂原子的环成员的5、6或7元环,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多3个N,其中至多2个碳原子环成员独立地选自C(=O)和C(=S),并且所述硫原子环成员独立地选自S(=O)_n,各个环未被取代或者被至多3个独立地选自R³的取代基取代。这些5、6-和7元环包含A环成员连接以形成所述环的咪唑鎓氮和碳原子,如以下结构所示,其中R表示选自如上文定义环成员,并且a为0、1、2或3。



[0053] 在以上详述中,术语“烷基”,单独使用或在复合词如“烷硫基”或“卤代烷基”中使用,包括直链或支链烷基,诸如甲基、乙基、正丙基、异丙基、或不同的丁基、戊基、或己基异构体。“烯基”包括直链或支链的烯烃,诸如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、以及不同的丁烯基、戊烯基和己烯基异构体。“烯基”还包括聚烯,诸如1,2-丙二烯基和2,4-己二烯基。“炔基”包括直链或支链的炔烃,诸如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、以及不同的丁炔基、戊炔基和己炔基异构体。“炔基”还可包括由多个三键构成的部分,诸如2,5-己二炔基。

[0054] “烷氧基”包括例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基和不同的丁氧基、戊氧基

和己氧基异构体。“烷硫基”包括支链或直链的烷硫基部分,诸如甲硫基、乙硫基、以及不同的丙硫基、丁硫基、戊硫基和己硫基异构体。

[0055] “环烷基”包括例如环丙基、环丁基、环戊基和环己基。

[0056] 术语“卤素”,单独地或在复合词如“卤代烷基”中,或者当在描述如“被卤素取代的烷基”中使用,包括氟、氯、溴或碘。此外,当在复合词如“卤代烷基”中使用,或者当在描述如“被卤素取代的烷基”中使用,所述烷基可以是被卤素原子(其可以是相同的或不同的)部分地或完全地取代的。“卤代烷基”或“被卤素取代的烷基”的实例包括 $\text{F}_3\text{C}-$ 、 ClCH_2- 、 CF_3CH_2- 和 CF_3CCl_2- 。术语“卤代环烷基”、“卤代烷氧基”、“卤代烷硫基”、“卤代烯基”等类似于术语“卤代烷基”定义。“卤代烷氧基”的实例包括 $\text{CF}_3\text{O}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 和 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}-$ 。“卤代烷硫基”的实例包括 $\text{CCl}_3\text{S}-$ 、 $\text{CF}_3\text{S}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}-$ 和 $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 。

[0057] 如本文所用的化学缩写 $\text{S}(0)$ 和 $\text{S}(=0)$ 表示亚磺酰基部分。如本文所用的化学缩写 SO_2 、 $\text{S}(0)_2$ 和 $\text{S}(=0)_2$ 表示磺酰基部分。如本文所用的化学缩写 $\text{C}(0)$ 和 $\text{C}(=0)$ 表示羰基部分。如本文所用的化学缩写 CO_2 、 $\text{C}(0)_2$ 和 $\text{C}(=0)_2$ 表示氧基羰基部分。“ CHO ”是指甲酰基。

[0058] 在取代基中的碳原子的总数用“ C_i-C_j ”前缀表示。例如, C_1-C_6 烷基表示甲基、乙基和各种丙基、丁基、戊基和己基异构体。

[0059] 当化合物被带有表明取代基的数目可大于1的下标的取代基取代时,所述取代基(当它们大于1时)独立地选自所定义的取代基的组。此外,当下标表明范围(例如 $(\text{R})_{i-j}$)时,则取代基的数目可选自包括端点在内的介于 i 和 j 之间的整数。当基团包含可以是氢的取代基时,则当该取代基为氢时,认为这相当于所述基团未被取代。当基团上的一个或多个位置被描述成“未被取代”或“未取代”,则可以连接氢原子以占据任何自由价。

[0060] 除非另有说明,否则作为式1的组分的“环”或“环系”(例如,取代基 R^1)是碳环或杂环。术语“环系”表示两个或更多个耦合的环。术语“双环环系”和“耦合双环环系”表示由两个耦合的环组成的环系,其可以是“邻位耦合”、“桥接双环”或“螺双环”。“邻位耦合双环环系”表示其中两个组分环共同具有两个相邻的原子的环系。“桥接双环环系”通过将其中一个或多个原子的片段结合到环的不相邻环成员上来形成。“螺双环环系”通过将两个或更多个原子的片段结合到环的同一环成员上来形成。术语“耦合杂双环环系”表示其中至少一个环原子不是碳的耦合双环环系。术语“环成员”是指形成环或环系的骨架的原子或其他部分(例如, $\text{C}(=0)$ 、 $\text{C}(=\text{S})$ 、 $\text{S}(0)$ 或 $\text{S}(0)_2$)。

[0061] 术语“碳环(carbocyclic ring)”、“碳环(carbocycle)”或“碳环体系”表示其中形成环骨架的原子仅选自碳的环或环系。术语“杂环(heterocyclic ring)”、“杂环(heterocycle)”或“杂环环系”表示其中至少一个形成环骨架的原子不是碳(例如,氮、氧或硫)的环或环系。通常,杂环包含不超过4个氮、不超过2个氧和不超过2个硫。除非另外指明,碳环或杂环可以是饱和或不饱和的环。“饱和的”是指具有由通过单键彼此连接的原子组成的骨架的环;除非另外指明,其余的原子化合价被氢原子占据。除非另外说明,“不饱和环”可以是部分不饱和的或完全不饱和的。表述“完全不饱和的环”意指原子的环,其中在该环中的原子之间的键根据价键理论是单键或双键,并且此外该环中的原子之间的键包括尽可能多的双键,但没有累积双键(即没有 $\text{C}=\text{C}=\text{C}$ 或 $\text{C}=\text{C}=\text{N}$)。术语“部分不饱和的环”表示包含至少一个环成员通过双键键合到邻近环成员的环,并且在概念上可能在相邻环成员之间容纳大于存在的双键(即为其部分不饱和形式)数目的若干非累积双键(即,为其完全不饱

和的对应形式)。

[0062] 除非另外指明,杂环和环系可通过任何可用的碳或氮经由替换在所述碳或氮上的氢来连接。

[0063] “芳族的”表示每个环原子基本上在相同的平面上且具有垂直于该环平面的p-轨道,且其中 $(4n+2)$ 个 π 电子(其中n是正整数)与该环相关联以符合休克尔规则。术语“芳族环系”表示其中所述环系中的至少一个环是芳香性的碳环环系或杂环环系。当完全不饱和的碳环满足休克尔规则时,则所述环还被称为“芳环”或“芳族碳环”。

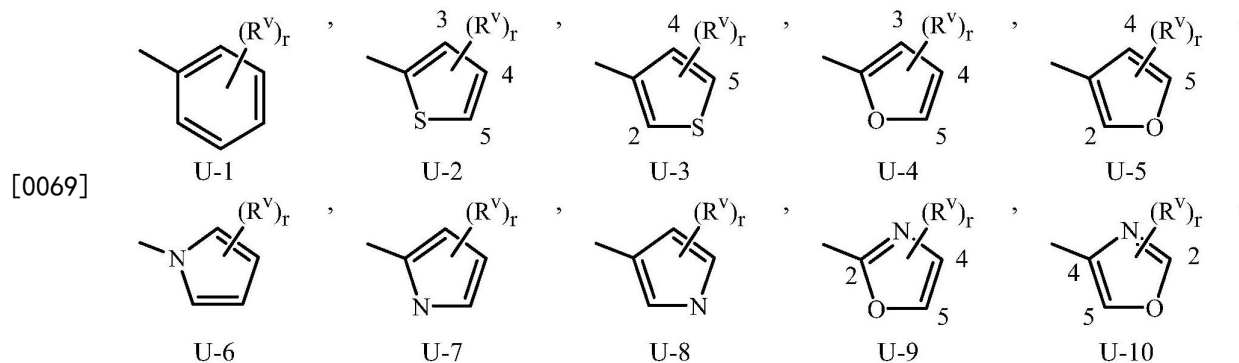
[0064] 术语“芳族碳环环系”是指碳环环系,其中所述环系的至少一个环是芳香性的。当完全不饱和的杂环满足休克尔规则时,则所述环还被称为“杂芳环”、“芳族杂环”或“杂环芳族环”。术语“芳族杂环环系”是指杂环环系,其中所述环系中的至少一个环是芳香性的。术语“非芳族环系”表示碳环或杂环环系,其可以是完全饱和的以及部分或完全不饱和的,只要该环系中的没有环是芳香性的。术语“非芳族碳环环系”表示其中环系中没有环是芳香性的碳环。术语“非芳族杂环环系”是指其中环系中没有环为芳香性的杂环环系。

[0065] 与杂环有关的术语“任选地取代的”是指这样的基团,其为未取代的或具有至少一个不消除由未取代的类似物所拥有的生物活性的非氢取代基。如本文所用,除非另外指明,将应用下列定义。术语“任选地取代的”与短语“取代或未取代的”或与术语“(未)取代的”可互换使用。除非另外指明,任选地取代的基团可在基团的各个可取代的位置处具有取代基,并且各个取代彼此独立。

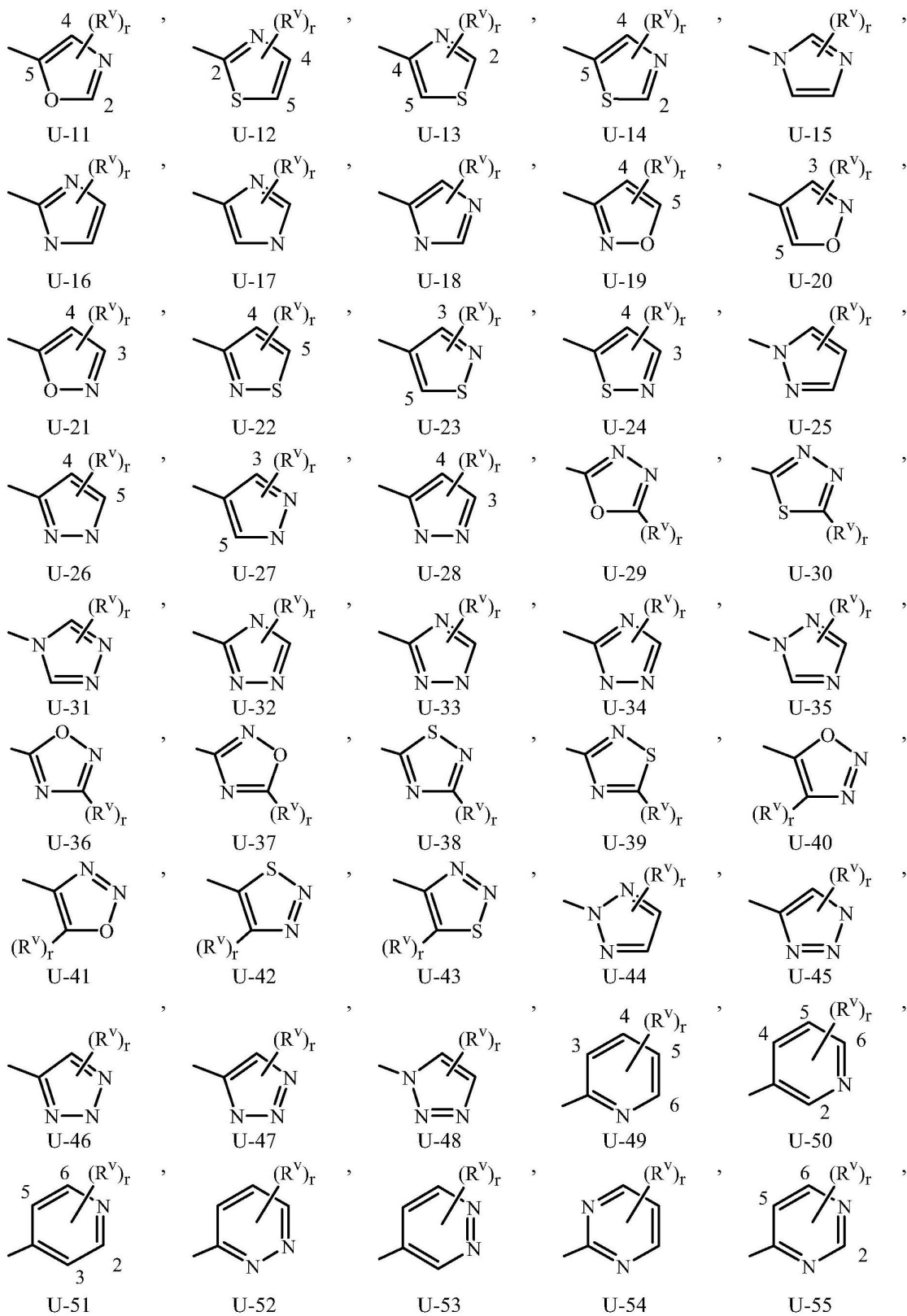
[0066] 当取代基是5或6元含氮杂环时,除非另有说明,其可通过任何可用的碳或氮环原子连接至式1的其余部分。如上所指出, R^1 可以是(尤其)任选地被一个或多个取代基取代的苯基,该一个或多个取代基选自如在发明概述中所定义的取代基。任选地被一至五个取代基取代的苯基的实例是如在示例1中的U-1所示的环,其中, R^v 是如在发明概述中对于 R^1 所定义的 R^x ,并且r是从0到5的整数。

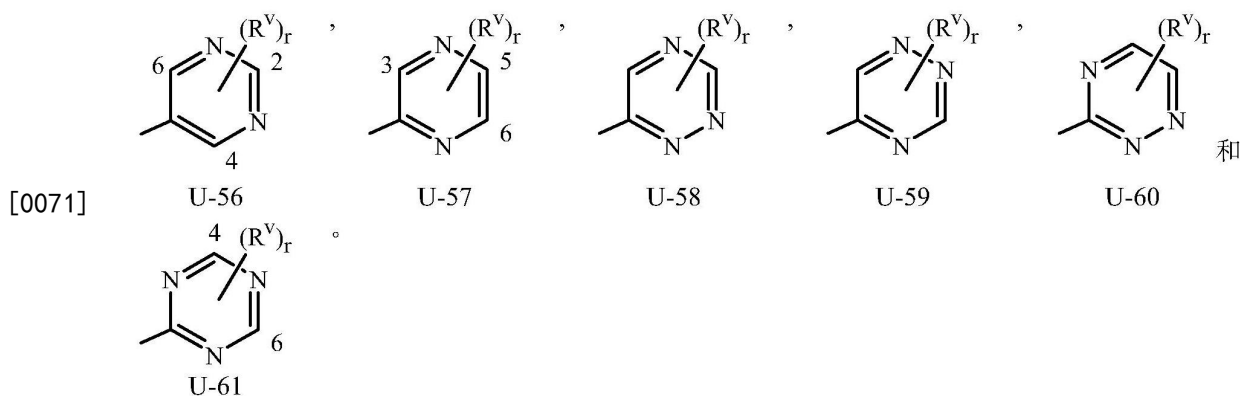
[0067] 如上所指出, R^1 可以是(尤其)5或6元杂环芳族环,任选地被一个或多个选自如在发明概述中所定义的取代基的取代基取代。任选地被一个或多个取代基取代的5或6元不饱和的芳族杂环的实例包括示例1中所示的环U-2至U-61,其中 R^v 是如在发明概述中对于 R^1 所定义的任何取代基,并且r为从0至4的整数,受限于每个U基团上的可用位置的数目。由于U-29、U-30、U-36、U-37、U-38、U-39、U-40、U-41、U-42和U-43仅有一个可用位置,所以对于这些U基团,r限于整数0或1,并且r是0意指该U基团是未取代的,并且氢存在于由 $(R^v)_r$ 所指示的位置处。

[0068] 示例1



[0070]





[0072] 虽然在结构U-1至U-61中示出 R^V 基团,但是应注意到,因为它们是任选的取代基,所以它们不必存在。应注意到,当 R^V 为H时,当连接到原子上时,这如同所述原子为未取代的一样。需要取代以填充其化合价的氮原子被H或 R^V 取代。应注意到,当 $(R^V)_r$ 与U基团之间的连接点示出为不固定时, $(R^V)_r$ 可连接到U基团的任何可用的碳原子或氮原子。应注意到,当U基团上的连接点示出为不固定时,U基团可通过U基团的任何可用的碳或氮经由替换氢原子而连接到式1的其余部分。应注意到,一些U基团仅能被少于4个 R^V 基团取代(例如U-2至U-5、U-7至U-48、以及U-52至U-61)。

[0073] 本领域中已知多种合成方法能够制备芳族和非芳族的杂环和环体系;对于广泛的评论,参见八卷集的Comprehensive Heterocyclic Chemistry[综合杂环化学],A.R.Katritzky和C.W.Rees主编,Pergamon Press,Oxford[培格曼出版社,牛津],1984和十二卷集的Comprehensive Heterocyclic Chemistry II,A.R.Katritzky,C.W.Rees和E.F.V. Scriven主编,Pergamon Press,Oxford,1996。

[0074] 本发明的化合物可作为一种或多种立体异构体存在。立体异构体为构成相同但它们的原子在空间中的排列不同的异构体,并且包括对映异构体、非对映异构体、顺-反异构体(还称为几何异构体)和阻转异构体。阻转异构体起因于围绕单键的旋转受限制,其中旋转能垒足够高以允许同分异构物种的分离。本领域的技术人员会理解,一种立体异构体当相对于一种或多种其他立体异构体富集时,或当与一种或多种其他立体异构体分离时,可能更有活性和/或可能表现出有益的效果。另外,熟练的技术人员知道如何分离、富集和/或选择性地制备所述立体异构体。对于立体异构现象的所有方面的综合讨论,参见Ernest L.Eliel和Samuel H.Wilen的Stereochemistry of Organic Compounds[有机化合物立体化学],John Wiley&Sons[约翰威立父子出版社],1994。

[0075] 本发明包括所有比例以及同位素形式(诸如氘代化合物)的所有立体异构体、构象异构体以及它们的混合物。

[0076] 本领域的技术人员会理解,不是所有的含氮杂环都可以形成N-氧化物,因为氮需要可用的孤电子对以氧化成氧化物;本领域的技术人员会认出可形成N-氧化物的那些含氮杂环。本领域技术人员还会认识到叔胺能够形成N-氧化物。用于制备杂环和叔胺的N-氧化物的合成方法是本领域的技术人员非常熟知的,包括使用过氧酸诸如过氧乙酸和3-氯过氧苯甲酸(MCPBA)、过氧化氢、烷基氢过氧化物诸如叔丁基氢过氧化物、过硼酸钠和二环氧乙烷诸如二甲基二环氧乙烷来氧化杂环和叔胺。用于制备N-氧化物的这些方法已被广泛描述和综述于文献中,参见例如:T.L.Gilchrist,Comprehensive Organic Synthesis[综合有

机合成],第7卷,第748-750页,S.V.Ley编辑,Pergamon Press;M.Tisler和B.Stanovnik,Comprehensive Heterocyclic Chemistry,第3卷,第18-20页,A.J.Boulton和A.McKillop编辑,Pergamon Press;M.R.Grimmett和B.R.T.Keene,Advances in Heterocyclic Chemistry[杂环化学进展],第43卷,第149-161页,A.R.Katritzky编辑,Academic Press[学术出版社];M.Tisler和B.Stanovnik,Advances in Heterocyclic Chemistry,第9卷,第285-291页,A.R.Katritzky和A.J.Boulton编辑,Academic Press;和G.W.H.Cheeseman和E.S.G.Werstiuk,Advances in Heterocyclic Chemistry,第22卷,第390-392页,A.R.Katritzky和A.J.Boulton编辑,学术出版社。

[0077] 本领域的技术人员认识到,由于在环境中和在生理条件下化合物的盐与它们相应的非盐形式处于平衡,因此盐共享非盐形式的生物效用。因此,多种式1的化合物的盐可用于防治无脊椎害虫。式1的化合物的盐包括与无机酸或有机酸的酸加成盐,所述酸诸如氢溴酸、盐酸、硝酸、磷酸、硫酸、乙酸、丁酸、富马酸、乳酸、马来酸、丙二酸、草酸、丙酸、水杨酸、酒石酸、4- 甲苯磺酸或戊酸。当式1的化合物包含酸性部分诸如羧酸或苯酚时,盐还包括与有机碱或无机碱形成的那些,所述碱诸如吡啶、三乙胺或氨、或钠、钾、锂、钙、镁或钡的酰胺、氢化物、氢氧化物或碳酸盐。因此,本发明包括选自式1、其N-氧化物和合适的盐的化合物。

[0078] 选自式1、其立体异构体、互变异构体、N-氧化物和盐的化合物通常以多于一种形式存在,并且因此式1包括式1表示的所有结晶和非结晶形式的化合物。非结晶形式包括为固体的实施方案诸如蜡和树胶,以及为液体的实施方案诸如溶液和熔融物。晶体形式包括代表基本上单晶类型的实施方案和代表多晶型物(即不同结晶类型)的混合物的实施方案。术语“多晶型物”是指可以以不同晶型结晶的化合物的具体晶型,这些晶型在晶格中具有不同的分子排列和/或构象。虽然多晶型物可具有相同的化学组成,但是它们也可以在组成上由于共结晶水或其他分子的存在或不存在而不同,该共结晶水或其他分子可弱结合或强结合在晶格内。多晶型物可以在这样的化学、物理、和生物特性方面不同,诸如晶体形状、密度、硬度、颜色、化学稳定性、熔点、吸湿性、可悬浮性、溶解速率和生物利用度。本领域的技术人员会理解,相对于由式1表示的相同化合物的另一种多晶型物或多晶型物的混合物,由式1表示的化合物的多晶型物可展现出有益效果(例如适合制备有用制剂,改善的生物性能)。由式1表示的化合物的具体多晶型物的制备和分离可通过本领域技术人员已知的方法实现,包括例如采用所选溶剂和温度的结晶。本发明的化合物可作为一种或多种结晶多晶型物存在。本发明包括单独多晶型物和多晶型物的混合物二者,包括相对于其他富集一种多晶型物的混合物。对于多晶型现象的综合讨论,参见R.Hilfiker编辑的Polymorphism in the Pharmaceutical Industry[制药工业的多晶型现象],Wiley-VCH,Weinheim[魏因海姆],2006。

[0079] 本发明的如在发明概述中所述的实施方案包括下述的那些。在下列实施方案中,除非在实施方案中另外定义,对“式1的化合物”的提及包括在发明概述中说明的取代基的定义。

[0080] 实施方案1.式1的化合物,其中A为含有选自碳原子和至多3个杂原子的环成员的5或6元环,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多3个N,其中至多2个碳原子环成员独立地选自C(=O)和C(=S),并且所述硫原子环成员独立地选自S(=O)_n,各个环未被取

代或者被至多3个独立地选自 R^3 的取代基取代。

[0081] 实施方案2. 式1的化合物, 其中A为含有选自碳原子和至多3个杂原子的环成员的5元环, 所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多3个N, 其中至多2个碳原子环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$, 并且所述硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_n$, 各个环未被取代或者被至多3个独立地选自 R^3 的取代基取代。

[0082] 实施方案3. 式1的化合物, 其中A为含有选自碳原子和至多3个杂原子的环成员的6元环, 所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多3个N, 其中至多2个碳原子环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$, 并且所述硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_n$, 各个环未被取代或者被至多3个独立地选自 R^3 的取代基取代。

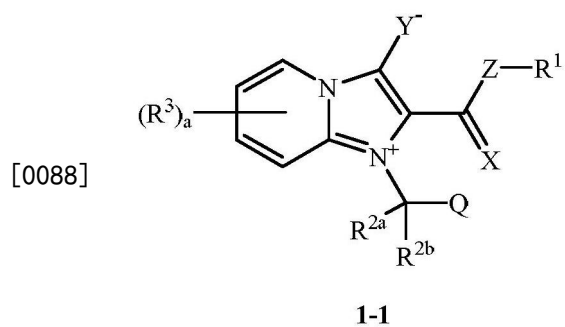
[0083] 实施方案4. 式1的化合物, 其中A为含有选自碳原子和至多3个杂原子的环成员的5元环, 所述杂原子独立地选自至多1个O、至多1个S和至多2个N, 其中至多1个碳原子环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$, 并且所述硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_n$, 各个环未被取代或者被至多3个独立地选自 R^3 的取代基取代。

[0084] 实施方案5. 式1的化合物, 其中A为含有选自碳原子和至多3个杂原子的环成员的6元环, 所述杂原子独立地选自至多1个O、至多1个S和至多2个N, 其中至多1个碳原子环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$, 并且所述硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_n$, 各个环未被取代或者被至多3个独立地选自 R^3 的取代基取代。

[0085] 实施方案6. 式1的化合物, 其中A为含有选自碳原子和至多2个杂原子的环成员的5元环, 所述杂原子独立地选自至多1个O、至多1个S和至多2个N, 各个环未被取代或者被至多3个独立地选自 R^3 的取代基取代。

[0086] 实施方案7. 式1的化合物, 其中A为含有选自碳原子和至多2个杂原子的环成员的6元环, 所述杂原子独立地选自至多1个O、至多1个S和至多2个N, 各个环未被取代或者被至多3个独立地选自 R^3 的取代基取代。

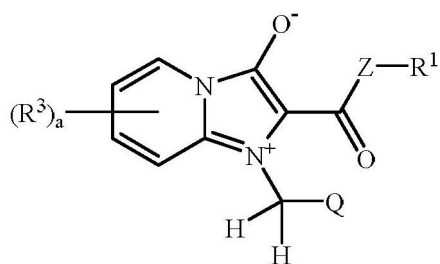
[0087] 实施方案8. 式1的化合物, 其具有式1-1的结构



[0089] 其中a为0、1、2或3。

[0090] 实施方案8a. 式1的化合物, 其具有式1-2的结构

[0091]

**1-2**

;

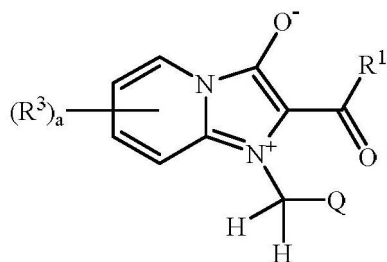
[0092]

其中R³为F、Cl或CH₃,并且a为0或1。

[0093]

实施方案8b.式1的化合物,其具有式1-3的结构(式1-2,其中Z为直接键)

[0094]

**1-3**

;

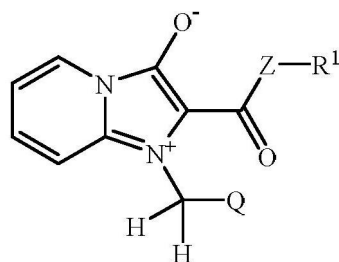
[0095]

其中R³为F、Cl或CH₃,并且a为0或1。

[0096]

实施方案8c.式1的化合物,其具有式1-4的结构

[0097]

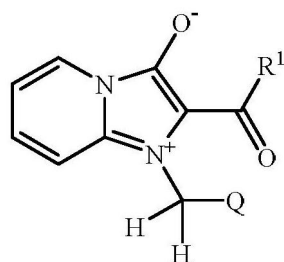
**1-4**

。

[0098]

实施方案8d.式1的化合物,其具有式1-5的结构(式1-4,其中Z为直接键)

[0099]

**1-5**

。

[0100]

实施方案9.式1的化合物,其中X和Y中一个为氧,并且一个为硫。

[0101]

实施方案9a.式1的化合物,其中X和Y为氧。

[0102]

实施方案10.式1的化合物,其中Z为直接键。

[0103]

实施方案11.式1的化合物,其中Z为含有选自碳原子和至多2个杂原子的链成员的1至4个原子链,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多2个N,其中至多2个碳原

子链成员独立地选自C(=O)和C(=S),并且所述硫原子链成员独立地选自S(=O)_n,各个1至4个原子链未被取代或者被至多4个独立地选自R⁵的取代基取代,或者当R⁵为卤素时,被至多9个卤素取代。

[0104] 实施方案12.式1的化合物,其中Z为含有选自碳原子和至多1个杂原子的链成员的1至4个原子链,所述杂原子独立地选自O、S和N,其中至多1个碳原子链成员独立地选自C(=O)和C(=S),并且所述硫原子链成员独立地选自S(=O)_n,各个1至4个原子链未被取代或者被至多4个独立地选自R⁵的取代基取代,或者当R⁵为卤素时,被至多9个卤素取代。

[0105] 实施方案13.式1的化合物,其中Z为含有选自碳原子1至4个原子链,其中至多1个碳原子链成员独立地选自C(=O)和C(=S),各个1至4个原子链未被取代或者被至多4个独立地选自R⁵的取代基取代,或者当R⁵为卤素时,被至多9个卤素取代。

[0106] 实施方案13a.式1的化合物,其中Z为CH₂。

[0107] 实施方案13b.式1的化合物,其中Z为O。

[0108] 实施方案14.式1的化合物,其中R¹为H或卤素。

[0109] 实施方案14a.式1的化合物,其中Z为被至多8个卤素取代的1-至4个碳原子链,并且R¹为H或卤素。

[0110] 实施方案14b.式1的化合物,其中Z为被至多8个F取代的1-至4个碳原子链,并且R¹为H或F。

[0111] 实施方案14c.式1的化合物,其中Z为CH₂并且R¹为卤素。

[0112] 实施方案14d.式1的化合物,其中Z为CH₂并且R¹为Cl。

[0113] 实施方案15.式1的化合物,其中R¹为3至10元环或7至11元环系,各个环或环系含有选自碳原子和至多4个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多4个N,其中至多3个碳原子环成员独立地选自C(=O)和C(=S),并且所述硫原子环成员独立地选自S(=O)_u(=NR¹⁹)_z,各个环或环系未被取代或者被至多8个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0114] 实施方案15a.式1的化合物,其中R¹为C₃-C₇环烷基,其未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0115] 实施方案15b.式1的化合物,其中Z为直接键,并且R¹为C₃-C₇环烷基,其未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0116] 实施方案16.式1的化合物,其中R¹为5至7元环或7至11元环系,各个环或环系含有选自碳原子和至多4个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多4个N,其中至多3个碳原子环成员独立地选自C(=O)和C(=S),并且所述硫原子环成员独立地选自S(=O)_u(=NR¹⁹)_z,各个环或环系未被取代或者被至多8个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0117] 实施方案17.式1的化合物,其中R¹为5至7元环,各个环含有选自碳原子和至多3个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多1个O、至多1个S和至多3个N,其中至多1个碳原子环成员独立地选自C(=O)和C(=S),并且所述硫原子环成员独立地选自S(=O)_u(=NR¹⁹)_z,各个环未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0118] 实施方案18.式1的化合物,其中R¹为7至11元环系,各个环系含有选自碳原子和至多4个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多1个O、至多1个S和至多4个N,其中至多1

个碳原子环成员独立地选自C(=O)和C(=S),并且所述硫原子环成员独立地选自S(=O)_u(=NR¹⁹)_z,各个环系未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0119] 实施方案19.式1的化合物,其中R¹为5或6元杂芳环,各个环含有选自碳原子和至多3个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多1个O、至多1个S和至多3个N,其中至多1个碳原子环成员独立地选自C(=O)和C(=S),并且所述硫原子环成员独立地选自S(=O)_u(=NR¹⁹)_z,各个环未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0120] 实施方案19a.式1的化合物,其中R¹为苯基;或者R¹为5或6元杂芳环,各个环含有选自碳原子和至多3个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多1个O、至多1个S和至多3个N,其中至多1个碳原子环成员独立地选自C(=O)和C(=S),并且所述硫原子环成员独立地选自S(=O)_u(=NR¹⁹)_z,各个环未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0121] 实施方案19b.式1的化合物,其中R¹为苯基;或者R¹为含有选自碳原子和至多3个N的环成员的6元杂芳环,各个苯基或6元杂芳环未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0122] 实施方案19c.式1的化合物,其中R¹为苯基或吡啶基,其各自未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0123] 实施方案19d.式1的化合物,其中R¹为苯基,其未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0124] 实施方案19e.式1的化合物,其中R¹为吡啶基,其各自未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0125] 实施方案19a1.式1的化合物,其中Z为直接键,并且R¹为苯基;或者R¹为5或6元杂芳环,各个环含有选自碳原子和至多3个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多1个O、至多1个S和至多3个N,其中至多1个碳原子环成员独立地选自C(=O)和C(=S),并且所述硫原子环成员独立地选自S(=O)_u(=NR¹⁹)_z,各个环未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0126] 实施方案19b1.式1的化合物,其中Z为直接键,并且R¹为苯基;或者R¹为含有选自碳原子和至多3个N的环成员的6元杂芳环,各个苯基或6元杂芳环未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0127] 实施方案19c1.式1的化合物,其中Z为直接键,并且R¹为苯基或吡啶基,其各自未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0128] 实施方案19d1.式1的化合物,其中Z为直接键,并且R¹为苯基,其未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0129] 实施方案19e1.式1的化合物,其中Z为直接键,并且R¹为吡啶基,其各自未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0130] 实施方案20.式1或实施方案19-19e1中任一项的化合物,其中各个R⁴独立地为C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基或C₁-C₄烷基硫基,其各自未被取代或者被卤素取代。

[0131] 实施方案21.式1的化合物,其中R^{2a}和R^{2b}各自独立地为H、卤素或C₁-C₂烷基;或者R^{2a}和R^{2b}共同形成含有碳原子和至多一个杂原子的3至4元环,所述杂原子选自O、N和S(O)_n。

[0132] 实施方案21a.式1的化合物,其中R^{2a}和R^{2b}各自独立地为H或甲基。

[0133] 实施方案22.式1的化合物,其中R^{2a}和R^{2b}为H。

[0134] 实施方案23. 式1的化合物, 其中Q为5元杂芳环, 其未被取代或者被至多3个独立地选自R⁶的取代基取代。

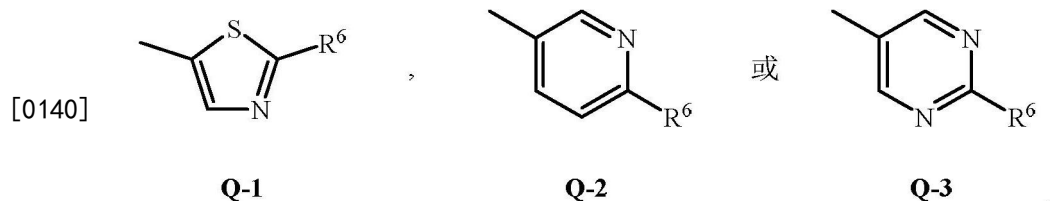
[0135] 实施方案24. 式1的化合物, 其中Q为6元杂芳环, 其未被取代或者被至多3个独立地选自R⁶的取代基取代。

[0136] 实施方案25. 式1的化合物, 其中Q为2-氯-5-噻唑基、2-溴-5-噻唑基、2-氟-5-噻唑基、2-甲基-5-噻唑基、2-(二氟甲基)-5-噻唑基、2-(三氟甲基)-5-噻唑基或5-噻唑基。

[0137] 实施方案26. 式1的化合物, 其中Q为2-氯-5-吡啶基、2-氟-5-吡啶基、2-溴-5-吡啶基、2-甲基-5-吡啶基、2-(二氟甲基)-5-吡啶基、2-(三氟甲基)-5-吡啶基或3-吡啶基。

[0138] 实施方案27. 式1的化合物, 其中Q为5-嘧啶基、2-氯-5-嘧啶基、2-氟-5-嘧啶基、2-溴-5-嘧啶基、2-甲基-5-嘧啶基、2-(二氟甲基)-5-嘧啶基或2-(三氟甲基)-5-嘧啶基。

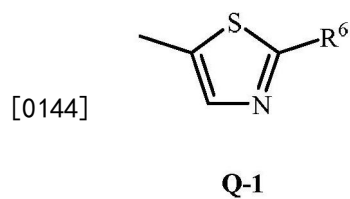
[0139] 实施方案28. 式1的化合物, 其中Q为



[0141] 实施方案28a. 实施方案28的化合物, 其中R⁶为H、卤素、C₁-C₄烷基或C₁-C₄卤代烷基。

[0142] 实施方案28b. 实施方案28的化合物, 其中R⁶为H、F、Cl、Br、CH₃、CHF₂或CF₃。

[0143] 实施方案29. 式1的化合物, 其中Q为



[0145] 实施方案29a. 实施方案29的化合物, 其中R⁶为H、卤素、C₁-C₄烷基或C₁-C₄卤代烷基。

[0146] 实施方案29b. 实施方案29的化合物, 其中R⁶为H、F、Cl、Br、CH₃、CHF₂或CF₃。

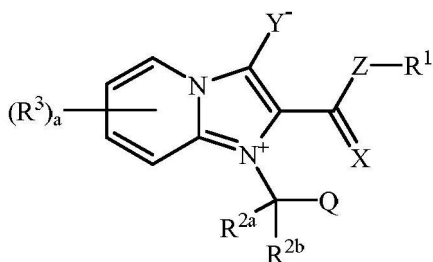
[0147] 实施方案29c. 式1的化合物, 其中Q为2-氯-5-噻唑基。

[0148] 本发明的实施方案, 包括以上的实施方案1-29c以及任何本文所述的其他实施方案, 可以以任何方式组合, 并且实施方案中的变量的描述不仅涉及式1的化合物, 而且还涉及对于制备式1的化合物有用的起始化合物和中间体化合物。此外, 本发明的实施方案, 包括以上的实施方案1-29c以及任何本文所述的其他实施方案以及其任何组合, 涉及本发明的组合物和方法。

[0149] 实施方案1-29c的组合由以下示出:

[0150] 实施方案A. 式1的化合物, 其具有式1-1的结构

[0151]



1-1

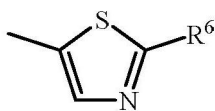
;

[0152] 其中a为0、1、2或3;

[0153] R^{2a}和R^{2b}为H;并且

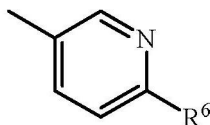
[0154] Q为

[0155]



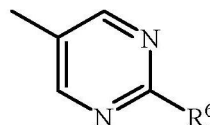
Q-1

,



Q-2

或



Q-3

。

[0156] 实施方案A1. 实施方案A的化合物, 其中

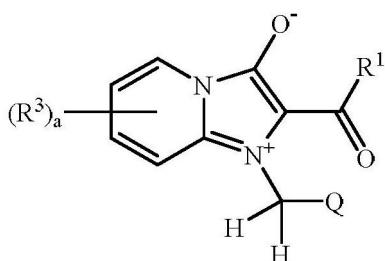
[0157] R⁶为H、卤素、C₁-C₄烷基或C₁-C₄卤代烷基。

[0158] 实施方案A2. 实施方案A1的化合物, 其中

[0159] R⁶为H、F、Cl、Br、CH₃、CHF₂或CF₃。

[0160] 实施方案B. 式1的化合物, 其具有式1-3的结构

[0161]



1-3

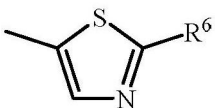
;

[0162] 其中R³为F、Cl或CH₃, 并且a为0或1; 并且[0163] R¹为苯基或吡啶基, 其各自未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。[0164] 实施方案B1. 实施方案B的化合物, 其中R¹为苯基, 其未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0165] 实施方案B2. 实施方案B或B1的化合物, 其中

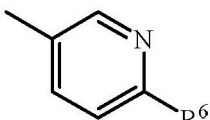
[0166] Q为

[0167]



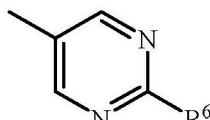
Q-1

,



Q-2

或



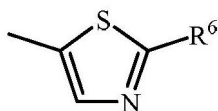
Q-3

。

[0168] 实施方案B3. 实施方案B2的化合物, 其中

[0169] R^6 为H、卤素、 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 卤代烷基。

[0170] 实施方案B4.实施方案B3的化合物,其中Q为



[0171]

Q-1

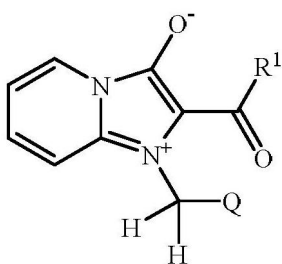
[0172] 实施方案B5.实施方案B4的化合物,其中

[0173] R^6 为H、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 或 CF_3 。

[0174] 实施方案B6.实施方案B5的化合物,其中

[0175] R^6 为Cl。

[0176] 实施方案C.式1的化合物,其具有式1-5的结构

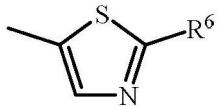


[0177]

1-5

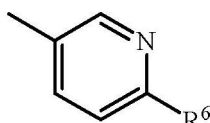
;

[0178] 其中Q为



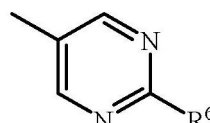
[0179]

Q-1



Q-2

或



Q-3

。

[0180] 实施方案C₁.实施方案C的化合物,其中

[0181] R^6 为H、卤素、 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 卤代烷基。

[0182] 实施方案C2.实施方案C1的化合物,其中

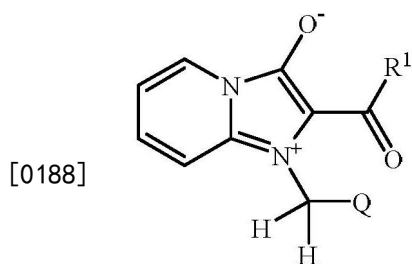
[0183] R^6 为H、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 或 CF_3 。

[0184] 实施方案C3.实施方案C2的化合物,其中

[0185] Q为Q-1;并且

[0186] R^6 为Cl。

[0187] 实施方案D.式1的化合物,其具有式1-5的结构



1-5

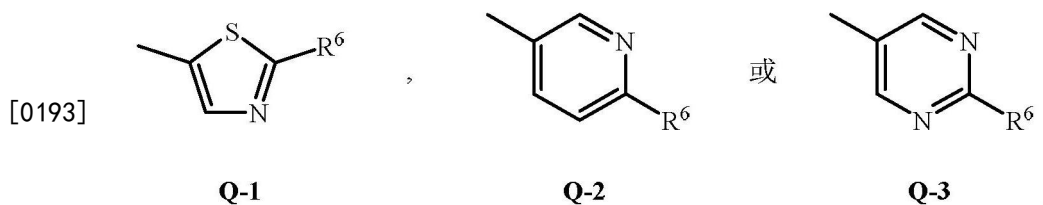
;

[0189] 其中R¹为苯基或吡啶基,其各自未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0190] 实施方案D1.实施方案D的化合物,其中R¹为苯基,其未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0191] 实施方案D2.实施方案D或D1的化合物,其中

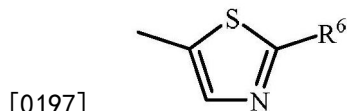
[0192] Q为



[0194] 实施方案D3.实施方案D2的化合物,其中

[0195] R⁶为H、卤素、C₁-C₄烷基或C₁-C₄卤代烷基。

[0196] 实施方案D4.实施方案D3的化合物,其中Q为



Q-1

。

[0198] 实施方案D5.实施方案D4的化合物,其中

[0199] R⁶为H、F、Cl、Br、CH₃、CHF₂或CF₃。

[0200] 实施方案D6.实施方案D5的化合物,其中

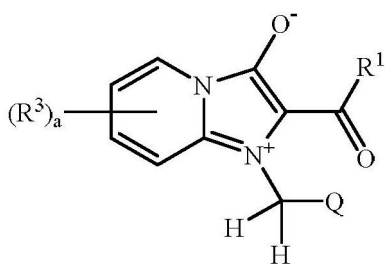
[0201] R⁶为Cl。

[0202] 实施方案D7.实施方案D或D1的化合物,其中

[0203] 各个R⁴独立地为C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基或C₁-C₄烷基硫基,其各自未被取代或者被卤素取代。

[0204] 实施方案E.式1的化合物,其具有式1-3的结构

[0205]

**1-3**

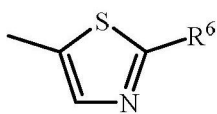
;

[0206] 其中R³为F、Cl或CH₃,并且a为0或1;

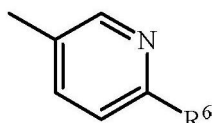
[0207] R¹为苯基或吡啶基,其各自未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代;

[0208] Q为

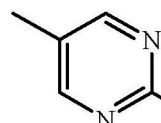
[0209]

**Q-1**

,

**Q-2**

或

**Q-3**

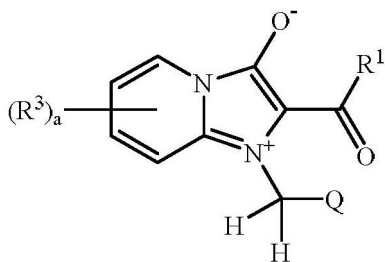
;

[0210] R⁶为H、卤素、C₁-C₄烷基或C₁-C₄卤代烷基。

[0211] 实施方案E1. 实施方案E的化合物,其中R¹为苯基,其未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0212] 实施方案F. 式1的化合物,其具有式1-3的结构

[0213]

**1-3**

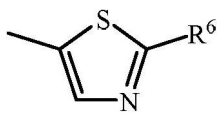
;

[0214] 其中R³为F、Cl或CH₃,并且a为0或1;

[0215] R¹为苯基或吡啶基,其各自未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代;

[0216] Q为

[0217]



;并且

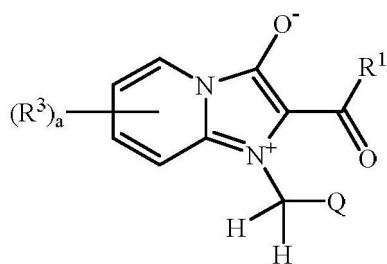
Q-1

[0218] R⁶为H、卤素、C₁-C₄烷基或C₁-C₄卤代烷基。

[0219] 实施方案F1. 实施方案F的化合物,其中R¹为苯基,其未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0220] 实施方案G. 式1的化合物,其具有式1-3的结构

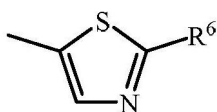
[0221]

**1-3**

;

[0222] 其中R³为F、Cl或CH₃,并且a为0或1;[0223] R¹为苯基或吡啶基,其各自未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代;

[0224] Q为



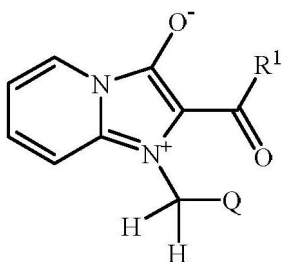
[0225]

;并且

Q-1[0226] R⁶为Cl。[0227] 实施方案G1.实施方案G的化合物,其中R¹为苯基,其未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0228] 实施方案H式1的化合物,其具有式1-5的结构

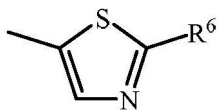
[0229]

**1-5**

;

[0230] 其中R¹为苯基或吡啶基,其各自未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代;[0231] 各个R⁴独立地为C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基或C₁-C₄烷基硫基,其各自未被取代或者被卤素取代;

[0232] Q为

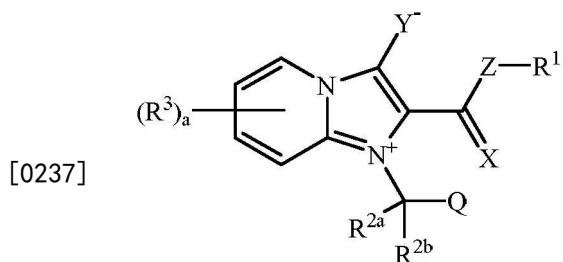


[0233]

;并且

Q-1[0234] R⁶为Cl。[0235] 实施方案H1.实施方案H的化合物,其中R¹为苯基,其未被取代或者被至多4个独立地选自R⁴的取代基取代。

[0236] 实施方案J. 式1的化合物, 其具有式1-1的结构



1-1

;

[0238] 其中a为0、1、2或3。

[0239] 实施方案J1. 实施方案J的化合物, 其中

[0240] X和Y为0;

[0241] R^{2a} 和 R^{2b} 为H。

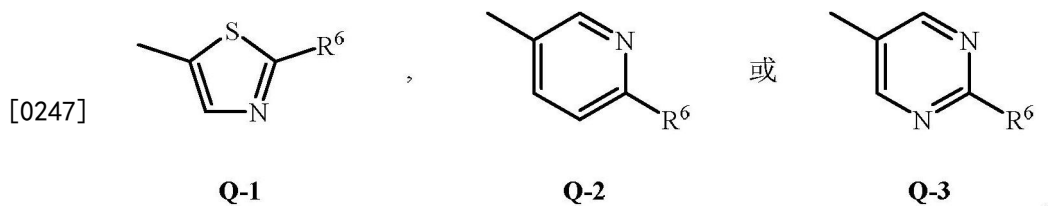
[0242] 实施方案J2. 实施方案J1的化合物, 其中

[0243] Z为直接键; 并且

[0244] R^1 为苯基或吡啶基, 其各自未被取代或者被至多4个独立地选自 R^4 的取代基取代。

[0245] 实施方案J3. 实施方案J2的化合物, 其中

[0246] Q为



[0248] 实施方案J4. 实施方案J3的化合物, 其中

[0249] R^1 为苯基, 其未被取代或者被至多4个独立地选自 R^4 的取代基取代;

[0250] R^3 为F、Cl或 CH_3 ;

[0251] a为0或1; 并且

[0252] R^6 为H、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 或 CF_3 。

[0253] 具体实施方案包括选自化合物1、3、5、6、16、25、27、28和29的式1的化合物。其它具体实施方案包括选自化合物1、3、5、6、7、16、21、25、27、28、29、43、46、47、48、50、57、58、61、62、63和81的式1的化合物。其它具体实施方案包括选自化合物3、6、25、48、57、72、76、92、94、98、121和127的式1的化合物。化合物编号参照索引表A。

[0254] 值得注意的是, 本发明的化合物的特征在于有利的代谢和/或土壤残留模式, 并表现出防治广谱的农学和非农学无脊椎害虫的活性。

[0255] 特别值得注意的是, 由于无脊椎害虫防治谱和经济重要性的原因, 通过防治无脊椎害虫保护农作物免受由无脊椎害虫引起的损害或伤害是本发明的实施方案。本发明的化合物由于其在植物中的有利的易位特性或内吸性还保护叶或不与式1的化合物或包含该化合物的组合物直接接触的其他植物部分。

[0256] 还值得注意的作为本发明的实施方案的是包含前述实施方案中任一项、以及本文所述的任何其他实施方案及其任何组合所述的化合物, 以及至少一种选自表面活性剂、固

体稀释剂和液体稀释剂的附加组分的组合物,所述组合物任选地还包含至少一种附加的生物学活性化合物或药剂。

[0257] 另外值得注意的作为本发明的实施方案的是用于防治无脊椎害虫的包含前述实施方案中任一项、以及本文所述的任何其他实施方案及其任何组合所述的化合物,以及至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的附加组分的组合物,所述组合物任选地还包含至少一种附加的生物学活性化合物或药剂。本发明的实施方案还包括用于防治无脊椎害虫的方法,这些方法包括使无脊椎害虫或其环境与生物学有效量的如前述实施方案中任一项所述的化合物(例如,以本文所述的组合物的形式)接触。

[0258] 本发明的实施方案还包括呈土壤浸液液体剂形式的包含如前述实施方案中任一项所述的化合物的组合物。本发明的实施方案还包括用于防治无脊椎害虫的方法,这些方法包括使土壤与作为土壤浸液的液体组合物接触,该土壤浸液包含生物学有效量的如前述实施方案中任一项所述的化合物。

[0259] 本发明的实施方案还包括用于防治无脊椎害虫的喷雾组合物,该喷雾组合物包含生物学有效量的如前述实施方案中任一项所述的化合物和抛射剂。本发明的实施方案还包括用于防治无脊椎害虫的诱饵组合物,该诱饵组合物包含生物学有效量的如前述实施方案中任一项所述的化合物、一种或多种食物材料、任选存在地引诱剂和任选存在地保湿剂。本发明的实施方案还包括用于防治无脊椎害虫的装置,该装置包括所述诱饵组合物和适配为接收所述诱饵组合物的壳体,其中该壳体具有至少一个开口,该开口被定尺寸以允许该无脊椎害虫通过该开口,使得该无脊椎害虫可以从该壳体外部的的位置接近所述诱饵组合物,并且其中该壳体还被适配为放置在该无脊椎害虫的潜在或已知活动的所在地中或附近。

[0260] 本发明的实施方案还包括用于保护种子免受无脊椎害虫的方法,这些方法包括使该种子与生物学有效量的如前述实施方案中任一项所述的化合物接触。

[0261] 本发明的实施方案还包括用于保护动物免受无脊椎寄生害虫的方法,这些方法包括向该动物施用杀寄生虫有效量的如前述实施方案中任一项所述的化合物。

[0262] 本发明的实施方案还包括用于防治无脊椎害虫的方法,这些方法包括使所述无脊椎害虫或其环境与生物学有效量的式1的化合物、其N-氧化物或盐(例如,以本文所述的组合物的形式)接触,条件是这些方法不是通过治疗对人或动物体进行药物处理的方法。

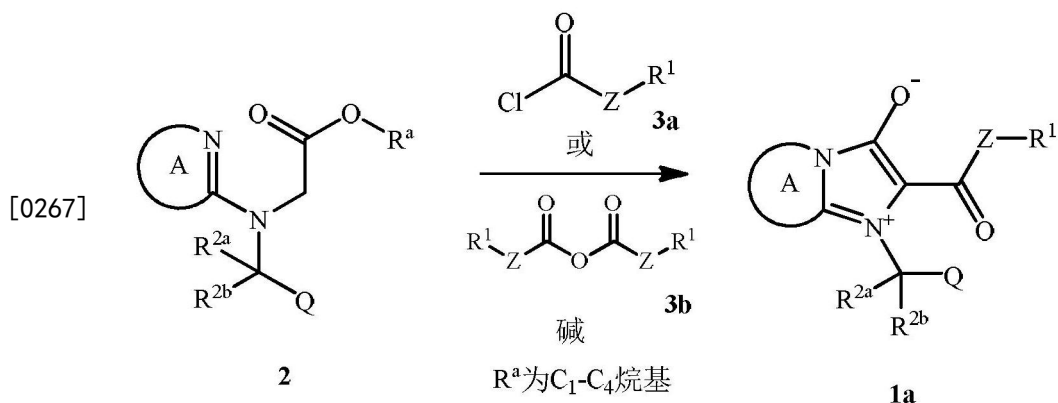
[0263] 本发明还涉及这样的方法,其中使所述无脊椎害虫或其环境与包含生物学有效量的式1的化合物、其N-氧化物或盐,以及至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的附加组分的组合物接触,所述组合物任选地还包含生物学有效量的至少一种附加的生物学活性化合物或药剂,条件是这些方法不是通过治疗对人或动物体进行药物处理的方法。

[0264] 式1的化合物可以通过如路线1-4中所述的以下方法和变型中的一种或多种来制备。除非另外注明,以下式1-7的化合物中取代基的定义如发明概述中所定义。式1a的化合物为式1的化合物的子集,并且式1a的所有取代基如上文对于式1所定义。可使用以下缩写:DMF为N,N-二甲基甲酰胺,并且DBU为1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯。

[0265] 式1a的化合物(式1的化合物,其中X和Y为O)可由式2的化合物通过路线1中所示方法制备。在该方法中,将式2的化合物用式3a的酰氯或式3b的酸酐在碱的存在下处理,并可将所得的反应混合物任选地加热。代表性反应溶剂包括乙腈、二氯甲烷、乙酸乙酯、甲苯、二

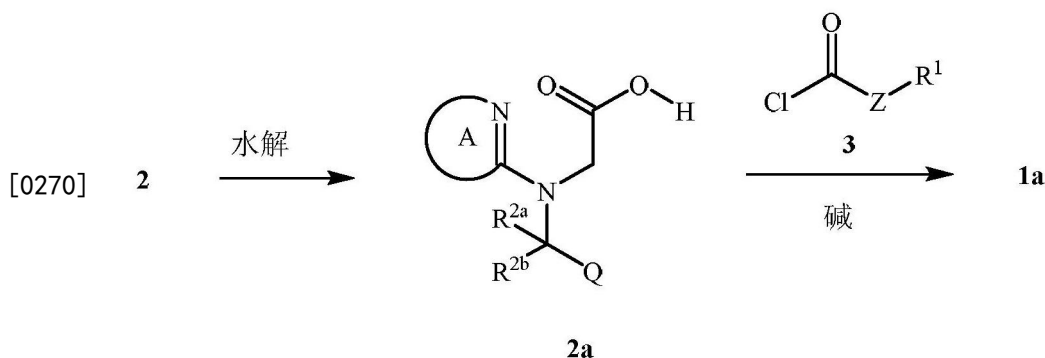
氯乙烷、四氢呋喃和DMF。代表性反应温度范围为25℃至100℃。可用于该步骤的代表性碱包括碳酸铯、碳酸钾、DBU、N,N-二异丙基乙基胺和三乙基胺。

[0266] 路线1



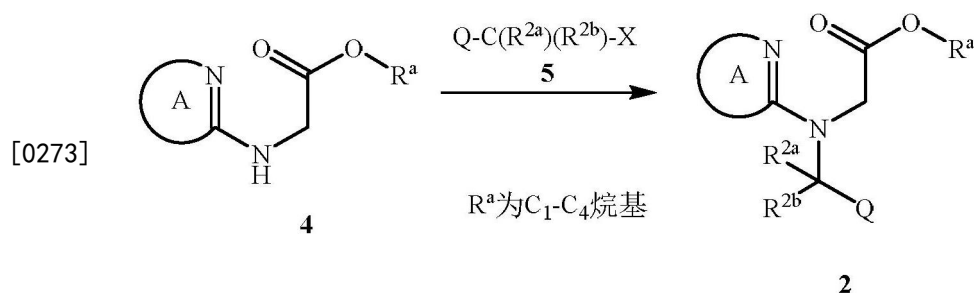
[0268] 式1a的化合物(式1的化合物,其中X和Y为O)也可由式2的化合物通过路线2中所示的两步法制备。在该方法中,式2a的化合物通过式2的化合物的酸性或碱性水解来制备。在碱性水解的情况下,代表性碱包括碱金属氢氧化物或四烷基氢氧化铵,并且代表性溶剂包括水、甲醇、乙醇和异丙醇或其混合物。代表性反应温度范围为0℃至反应溶剂的回流温度。在酸性水解的情况下,代表性溶剂包括质子溶剂(诸如水、甲醇或乙醇),或者非质子溶剂(诸如四氢呋喃、二氯甲烷或二氯乙烷)。代表性酸包括三氟乙酸或盐酸。代表性反应温度范围为-20℃至反应溶剂的回流温度。然后由式2a的化合物通过路线1中所述方法制备式1a的化合物。

[0269] 路线2



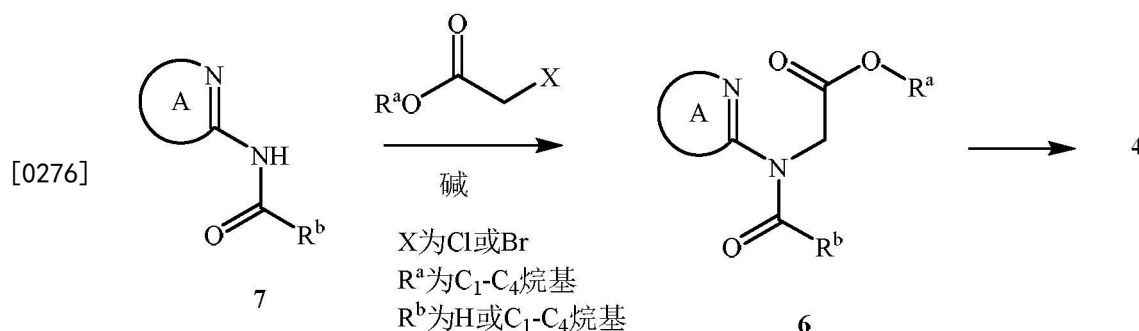
[0271] 式2的化合物可由式4的化合物通过路线3中所示方法制备。在该方法中,将式4的化合物通过用Q-C(R^{2a})(R^{2b})X(式5)在碱的存在下处理来烷基化,其中X为离去基团,诸如氯、溴、碘或磺酸酯。代表性反应溶剂包括乙腈、二氯甲烷、乙酸乙酯、四氢呋喃、二氯乙烷、乙醇、异丙醇和DMF。代表性反应温度范围为25℃至100℃。可用于该步骤的代表性碱包括氢氧化钠、碳酸铯、碳酸钾、DBU、N,N-二异丙基乙基胺和三乙基胺。

[0272] 路线3



[0274] 式4的化合物可由式7的化合物通过路线3中所示的两步法制备。在该方法的第一步中,将式7的化合物用C₁-C₄烷基氯乙酸酯或溴乙酸酯在碱存在下处理以得到式6的化合物。代表性反应溶剂包括乙腈、二氯甲烷、乙酸乙酯、二氯乙烷、四氢呋喃、DMF;代表性温度范围为-30℃至50℃。可用于该步骤的代表性碱包括氢化钠、碳酸铯、碳酸钾、DBU、N,N-二异丙基乙基胺和三乙胺。在该方法的第二步中,将式6的化合物的乙酸酯保护基通过酸性或碱性水解移除,以得到式4的化合物。

[0275] 路线4



[0277] 式1的化合物(其中X或Y为S)可由式1a的化合物通过用硫化试剂(诸如P4S10或劳森试剂(2,4-双(4-甲氧基苯基)-1,3-二硫杂-2,4-二磷杂环丁烷2,4-二硫化物))处理来制备。

[0278] 应认识到,上述对于制备式1的化合物所描述的某些试剂和反应条件可能与中间体中存在的某些官能团不相容。在这些情况下,将保护/去保护序列或官能团相互转换结合到合成中会有助于获得所期望的产物。保护基团的使用和选择对于化学合成领域的技术人员会是显而易见的(参见,例如,Greene, T.W.; Wuts, P.G.M. *Protective Groups in Organic Synthesis* [有机合成中的保护基团], 第2版; Wiley: 纽约, 1991)。本领域的技术人员会认识到,在一些情况下,在引入各个方案中所描绘的试剂之后,可能需要没有详细描述额外常规合成步骤以完成式1的化合物的合成。本领域的技术人员还会认识到,可能需要以与制备式1的化合物所呈现的具体序列不同的顺序来进行以上路线中示出的步骤的细合。

[0279] 本领域的技术人员还会认识到,本文所述的式1的化合物和中间体可经受各种亲电反应、亲核反应、自由基反应、有机金属反应、氧化反应和还原反应以添加取代基或改性现有的取代基。

[0280] 无需进一步详尽说明,据信本领域技术人员使用前述说明可将本发明利用至其最大程度。因此,以下合成例应被解释为仅仅是说明性的,并非以任何方式限制本公开。以下合成例中的步骤示出了在整体合成转化中每个步骤的程序,并且用于每个步骤的起始物质

并不必须由其程序描述于其他实施例或步骤中的具体制备试验来制备。百分比是按重量计,除了色谱溶剂混合物或除非另外指明之外。除非另外指明,色谱溶剂混合物的份数和百分比是按体积计。¹H NMR谱以距四甲基硅烷的低场的ppm来报告。“s”意指单峰、“d”意指双重峰、“t”意指三重峰、“q”意指四重峰、“m”意指多重峰、“dd”意指双重双峰、“dt”意指双重三峰、“br s”意指宽单峰。DMF意指N,N-二甲基甲酰胺。化合物编号参考索引表A。

[0281] 合成实施例1

[0282] 2-苯甲酰基-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-羟基咪唑并[1,2-a]吡啶鎓内盐(化合物1)的制备

[0283] 步骤A:N-甲酰基-N-2-吡啶基甘氨酸甲基酯的制备

[0284] 将N-2-吡啶基甲酰胺(9.7g,0.1mol)在无水DMF(100mL)中溶解,并在冰水浴中冷却。分批加入氢化钠(矿物油中60%分散液,6.0g,0.15mol);加入完成后,将反应混合物在继续冷却下搅拌10分钟。滴加溴乙酸甲酯(14.1mL,22.8g,0.15mol),然后将反应混合物在冰浴冷却下搅拌30分钟。然后将反应混合物小心地用饱和氯化铵溶液淬灭,并用乙酸乙酯萃取。将有机层分离,用盐水洗涤,干燥(硫酸镁)并浓缩为无色油(12.5g),将其在未进一步纯化下用于下一步骤。

[0285] 步骤B:N-2-吡啶基甘氨酸甲基酯的制备

[0286] 将N-甲酰基-N-2-吡啶基甘氨酸甲基酯(5.5g,28.4mmol)在2.75mL浓盐酸和30mL甲醇的溶液中溶解,并在环境温度下搅拌过夜。然后将反应混合物浓缩,并使其在饱和碳酸氢钠水溶液和乙酸乙酯之间分配。将有机层分离,干燥(硫酸镁)并浓缩以得到4.2g标题化合物。¹H NMR(400MHz,CDCl₃) δppm 8.14(d,1H),7.42(t,1H),6.61(t,1H),6.49(d,1H),5.06(br s,1H),4.21(d,2H),3.77(s,3H)。

[0287] 步骤C:N-[(2-氯噻唑-5-基)甲基]-N-2-吡啶基甘氨酸甲基酯的制备

[0288] 将N-2-吡啶基甘氨酸甲基酯(1.65g,10mmol)、2-氯-5-(氯甲基)噻唑(2.52g,15mmol)、四丁基碘化铵(0.37g,1mmol)和N-乙基-N-异丙基丙-2-胺(2.6g,3.4mL,20mmol)在干燥乙腈(15mL)中溶解,并在80℃下加热过夜。然后将反应混合物在硅胶上色谱纯化(使用含0-100%乙酸乙酯的己烷的梯度),以得到1.1g标题化合物。¹H NMR(400MHz,CDCl₃) δppm 8.22(d,1H),7.52(t,1H),7.45(s,1H),6.72(t,1H),6.56(d,1H),4.91(s,2H),4.22(s,2H),3.74(s,3H)。

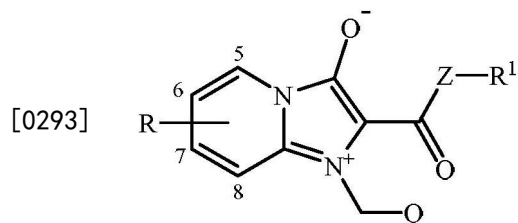
[0289] 步骤D:2-苯甲酰基-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-羟基咪并[1,2-a]吡啶鎓内盐的制备

[0290] 将N-[(2-氯噻唑-5-基)甲基]-N-2-吡啶基甘氨酸甲基酯(298mg,1mmol)和细磨的碳酸钾(165mg,1.2mmol)加入至乙腈(20mL),随后加入苯甲酰氯(0.35mL,0.42g,3mmol),并将反应混合物在80℃下加热过夜。加入另外部分的苯甲酰氯(0.35mL,0.42g,3mmol),并继续加热过夜。然后将反应混合物冷却,过滤,浓缩,并将所得残渣在硅胶上色谱纯化(使用含0-100%乙酸乙酯的己烷的梯度),以得到110mg的标题化合物(本发明的化合物)。¹H NMR(400MHz,CDCl₃) δppm 8.41(d,1H),7.92(m,2H),7.72(t,1H),7.64(s,1H),7.52(t,1H),7.46-7.48(m,3H),7.01(t,1H),5.92(s,2H)。

[0291] 通过如前述路线1-4和合成实施例1中所述的方法和变型制备的式1的具体化合物在以下索引表中示出。可使用以下缩写:Cmpd意指化合物,t是叔,c是环,Me是甲基,Et是乙

基且Ph是苯基。缩写“Ex.”代表“实施例”，后面跟着数字表示化合物在哪个合成实施例中制备。就质谱数据($AP^+(M+1)$)而言，记录的数值是采用大气压化学电离(AP^+)，由质谱观测到的 H^+ (分子量为1) 加在所述分子上获得M+1峰所形成的母分子离子的分子量(M)。没有报导包含多个卤素的化合物出现的其他分子离子峰(例如M+2或M+4)。

[0292] 索引表A



[0294]

Cmpd No.	R	Z	R ¹	Q	MS 数据
1	-	直接键	苯基	2-氯-5-噻唑基	370.4
2	-	直接键	3-(三氟甲基)苯基	2-氯-5-噻唑基	438.4
3	-	-CF ₂ -	F	2-氯-5-噻唑基	362.4
4	-	-CH ₂ O-	苯基	2-氯-5-噻唑基	400.5
5	-	直接键	4-(三氟甲基)苯基	2-氯-5-噻唑基	438.3
6	-	-CF ₂ CF ₂ -	F	2-氯-5-噻唑基	412.2
7	-	-CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ -	F	2-氯-5-噻唑基	512.1
8	-	直接键	4-(苄氧基)苯基	2-氯-5-噻唑基	476.2
9	-	直接键	3-(苄氧基)苯基	2-氯-5-噻唑基	476.2
10	-	-CH ₂ -	苯基	2-氯-5-噻唑基	384.3
11	-	-CHF-	F	2-氯-5-噻唑基	344.2
12	-	-CF ₂ -	苯基	2-氯-5-噻唑基	420.3
13	-	-CH ₂ -	3-(三氟甲基)苯基	2-氯-5-噻唑基	452.3
14	-	-CH ₂ -	4-(苄氧基)苯基	2-氯-5-噻唑基	490.3
15	-	直接键	6-氯-3-吡啶基	2-氯-5-噻唑基	405.1
16	-	直接键	2-甲氧基-4-吡啶基	2-氯-5-噻唑基	401.3
17	-	-CH ₂ -	4-(三氟甲基)苯基	2-氯-5-噻唑基	452.2
18	-	直接键	3-(三氟甲氧基)苯基	2-氯-5-噻唑基	454.2
19	-	直接键	3,5-二氯苯基	2-氯-5-噻唑基	438.1
20	-	直接键	3,4-二氯苯基	2-氯-5-噻唑基	438.0
21	-	直接键	2,4-二氯苯基	2-氯-5-噻唑基	438.1
22	-	直接键	3-甲基苯基	2-氯-5-噻唑基	384.2
23	-	直接键	4-甲基苯基	2-氯-5-噻唑基	384.2
24	-	直接键	4-(三氟甲硫基)苯基	2-氯-5-噻唑基	470.2
25	-	直接键	3-氯苯基	2-氯-5-噻唑基	404.0
26	-	直接键	4-氯苯基	2-氯-5-噻唑基	404.0

[0295]

27	-	直接键	2-氟苯基	2-氯-5-噻唑基	388.1
28	-	直接键	3-氟苯基	2-氯-5-噻唑基	388.1
29	-	直接键	4-氟苯基	2-氯-5-噻唑基	388.1
30	-	直接键	6-氯-2-吡啶基	2-氯-5-噻唑基	406
31	-	-O-	苯基	2-氯-5-噻唑基	386.0
32	-	直接键	5-氯-2-吡啶基	2-氯-5-噻唑基	406
33	-	直接键	3-甲氧基苯基	2-氯-5-噻唑基	400.1
34	-	直接键	4-甲氧基苯基	2-氯-5-噻唑基	400.2
35	-	直接键	4-(三氟甲氧基)苯基	2-氯-5-噻唑基	454.1
36	-	直接键	4-(异戊氧基)苯基	2-氯-5-噻唑基	456.2
37	-	直接键	4-(苯酰氧基(phenacyloxy))苯基	2-氯-5-噻唑基	504.2
38	-	直接键	2-氯-3-噻吩基	2-氯-5-噻唑基	411
39	-	直接键	2-吡啶基	2-氯-5-噻唑基	371
40	7-Me	直接键	苯基	2-氯-5-噻唑基	384.1
41	7-Me	直接键	3-(三氟甲基)苯基	2-氯-5-噻唑基	452.1
42	-	直接键	3-(三氟甲硫基)苯基	2-氯-5-噻唑基	470.2
43	-	直接键	2,3-二氟苯基	2-氯-5-噻唑基	406.2
44	-	直接键	2,3-二氟苯基	2-氯-5-噻唑基	406.2
45	-	直接键	2,3-二氟苯基	2-氯-5-噻唑基	406.2
46	-	直接键	2,6-二氟苯基	2-氯-5-噻唑基	406.2
47	-	直接键	3,5-二氟苯基	2-氯-5-噻唑基	406.2
48	-	直接键	2,4,6-三氟苯基	2-氯-5-噻唑基	424.1
49	-	直接键	4-氟-3-甲氧基苯基	2-氯-5-噻唑基	418.2
50	-	直接键	2-氟-3-甲氧基苯基	2-氯-5-噻唑基	418.2
51	-	直接键	3,5-二甲氧基苯基	2-氯-5-噻唑基	430.2
52	-	直接键	3-苯氧基苯基	2-氯-5-噻唑基	462.2
53	-	直接键	4-苯氧基苯基	2-氯-5-噻唑基	462.3
54	-	直接键	3-(2-甲氧基-2-氧代乙基)苯基	2-氯-5-噻唑基	442.3
55	-	直接键	3-溴-5-氟苯基	2-氯-5-噻唑基	466.1
56	-	直接键	2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	2-氯-5-噻唑基	472.2
57	-	直接键	4-溴-2-氯苯基	2-氯-5-噻唑基	482.1
58	-	直接键	3-氟-5-(三氟甲氧基)苯基	2-氯-5-噻唑基	471.2

[0296]

59	-	直接键	3-[[2-(三氟甲基)-4-吡啶基]氧基]苯基	2-氯-5-噻唑基	531.4
60	-	直接键	4-(2-苯基乙氧基)苯基	2-氯-5-噻唑基	490.4
61	-	直接键	2,3,6-三氟苯基	2-氯-5-噻唑基	424.2
62	-	直接键	2,6-二氟-4-甲氧基苯基	2-氯-5-噻唑基	436.3
63	-	直接键	4-溴-2,6-二氟苯基	2-氯-5-噻唑基	484.2
64	-	直接键	3-(2-甲氧基乙氧基)苯基	2-氯-5-噻唑基	443.3
65	-	直接键	3-氯-5-(三氟甲氧基)苯基	2-氯-5-噻唑基	488.3
66	-	直接键	5-氯-2-氟苯基	2-氯-5-噻唑基	422.3
67	-	直接键	5-溴-2-甲氧基苯基	2-氯-5-噻唑基	478.3
68	-	直接键	4-溴-2-氟苯基	2-氯-5-噻唑基	466.2
69	-	直接键	2-氯-4-氟苯基	2-氯-5-噻唑基	422.3
70	-	直接键	4-(2-甲氧基乙氧基)苯基	2-氯-5-噻唑基	444.4
71	-	直接键	4-氯-2-氟苯基	2-氯-5-噻唑基	422.2
72	-	直接键	5-溴-2-氟苯基	2-氯-5-噻唑基	466.2
73	-	直接键	3-[(6-氯-3-吡啶基)甲氧基]苯基	2-氯-5-噻唑基	511.4
74	-	直接键	4-(2-甲氧基-2-氧代-乙基)苯基	2-氯-5-噻唑基	442.2
75	-	直接键	2-氯-6-氟苯基	2-氯-5-噻唑基	422.2
76	-	直接键	2,5-二甲氧基苯基	2-氯-5-噻唑基	430.3
77	-	直接键	2-氯-4-氧基苯基	2-氯-5-噻唑基	429.3
78	-	直接键	2,3,4,5-四氟苯基	2-氯-5-噻唑基	442.3
79	-	直接键	2,4,6-三氯苯基	2-氯-5-噻唑基	472.3
80	7-甲基	O	苯基	2-氯-5-噻唑基	399.9
81	-	直接键	环丙基	2-氯-5-噻唑基	333.9
82	-	-CH=CH-	苯基	2-氯-5-噻唑基	396.9
83	-	直接键	环丁基	2-氯-5-噻唑基	348.2
84	-	-CH ₂ -	Cl	2-氯-5-噻唑基	341.9
85	-	-CH ₂ -	3-(三氟甲基)-1-吡啶基	2-氯-5-噻唑基	442.2
86	-	-CH ₂ -	4-氯-1-咪唑基	2-氯-5-噻唑基	407.9
87	-	直接键	2-氯-3-(三氟甲基)苯基	2-氯-5-噻唑基	472.3
88	-	直接键	2-氯-4-(甲基磺酰基)苯基	2-氯-5-噻唑基	482.3
89	-	直接键	2-甲基-4-(三氟甲基)-1-噻唑基	2-氯-5-噻唑基	459.3

[0297]

90	-	直接键	4-氰基-2-甲基苯基	2-氯-5-噻唑基	409.3
91	-	直接键	4-氰基-2-氟苯基	2-氯-5-噻唑基	413.3
92	-	直接键	2-氟-4-(三氟甲基)苯基	2-氯-5-噻唑基	456.3
93	-	直接键	2,6-二氟-4-(三氟甲基)苯基	2-氯-5-噻唑基	474.3
94	-	直接键	2-萘基	2-氯-5-噻唑基	420.2
95	-	直接键	6-异喹啉基	2-氯-5-噻唑基	421.2
96	-	直接键	2,4-二氯-6-氟苯基	2-氯-5-噻唑基	458.3
97	-	直接键	1-甲基-5-(三氟甲基)-4-吡唑基	2-氯-5-噻唑基	442.4
98	-	-OCH ₂ CH ₂ -	H	2-氯-5-噻唑基	338.1
100	-	-CH ₂ CH ₂ CF ₂ -	Cl	2-氯-5-噻唑基	406.1
101	-	-CH ₂ -	3-氯-1,2,4-三唑-1-基	2-氯-5-噻唑基	409.1
102	-	直接键	6-喹啉基	2-氯-5-噻唑基	421.2
103	-	-CH ₂ NH-	环丙基	2-氯-5-噻唑基	363.1
104	-	直接键	3,4-(亚甲基二氧基)苯基	2-氯-5-噻唑基	414.2
105	-	直接键	3,3-二氟环丁基	2-氯-5-噻唑基	384
106	-	直接键	4-溴-2,3,5,6-四氟苯基	2-氯-5-噻唑基	570.3
107	-	直接键	环己基	2-氯-5-噻唑基	376.1
108	-	直接键	3-异噁唑基	2-氯-5-噻唑基	361
109	-	直接键	4-噻唑基	2-氯-5-噻唑基	377
110	-	-C(O)OCH ₂ -	H	2-氯-5-噻唑基	352.1
111	-	-C(O)OCH ₂ CH ₂ -	H	2-氯-5-噻唑基	366.1
112	-	-O-	4-氯苯基	2-氯-5-噻唑基	420.1
113	-	-OCH ₂ -	H	2-氯-5-噻唑基	324.1
114	-	直接键	2,3-(亚甲基二氧基)苯基	2-氯-5-噻唑基	414.1
115	-	直接键	2,2-二氟-1,3-苯并二氧杂环戊烯-4-基	2-氯-5-噻唑基	450.1
116	-	-C(O)NH-	环丙基	2-氯-5-噻唑基	377
117	-	-C(O)-	苯基	2-氯-5-噻唑基	398.1
118	-	直接键	4-氰基-2,6-二氟苯基	2-氯-5-噻唑基	431.1
119	-	直接键	4-氰基-2,6-二氟苯基	2-溴-5-噻唑基	475.4
120	-	直接键	4-氰基-2-氟苯基	2-溴-5-噻唑基	457.4
121	-	直接键	3-氯-2-氟-5-(三氟甲基)苯基	2-氯-5-噻唑基	490.4

[0298]

122	-	直接键	2,4,6-三氟苯基	2-溴-5-噻唑基	468.4
123	-	直接键	3-溴-5-氯苯基	2-氯-5-噻唑基	482.3
124	-	直接键	4-溴-2,6-二氯苯基	2-氯-5-噻唑基	500.3
125	-	直接键	3-溴-4,6-二氟苯基	2-氯-5-噻唑基	484.1
126	-	直接键	1-萘基	2-氯-5-噻唑基	428.1
127	-	直接键	2,3-二氢-1,4-苯并二噁英-5-基	2-氯-5-噻唑基	428.1
128	-	直接键	4-氟-1-萘基	2-氯-5-噻唑基	438.2
129	-	直接键	5,6,7,8-四氢-1-萘基	2-氯-5-噻唑基	424
130	-	直接键	2,2-二氟-1,3-苯并二氧杂环戊烯-5-基	2-氯-5-噻唑基	450.1
131	-	直接键	5-苯并呋喃基	2-氯-5-噻唑基	410
132	-	-C(O)O-	氢	2-氯-5-噻唑基	424
133	-	-NH-	环丙基	2-氯-5-噻唑基	292
134	-	-O-	氢	2-氯-5-噻唑基	309.9
135	-	-NHCH ₂ CF ₂ -	F	2-氯-5-噻唑基	419
136	-	-C(O)NH-	4-氟苯基	2-氯-5-噻唑基	431
137	-	-CH ₂ -	3-氧基-1,2,4-三唑-1-基	2-氯-5-噻唑基	400.1
138	-	-CH ₂ -	3-甲氧羰基-1,2,4-三唑-1-基	2-氯-5-噻唑基	433.1
139	-	-CH ₂ -	3-溴-1,2,4-三唑-1-基	2-氯-5-噻唑基	454.9
140	-	-CH ₂ -	3-甲基-1,2,4-三唑-1-基	2-氯-5-噻唑基	389.1
141	-	直接键	5,6,7,8-四氢-2-萘基	2-氯-5-噻唑基	511.9
142	-	直接键	2,3-二氢-1,4-苯并二噁英-6-基	2-氯-5-噻唑基	428
143	-	-CH ₂ -	4-氯-1-吡唑基	2-氯-5-噻唑基	408
144	-	-CH ₂ -	3-甲氧羰基-1-吡唑基	2-氯-5-噻唑基	446.1
145	-	-CH ₂ NH-	苯基	2-氯-5-噻唑基	399
146	-	-CH ₂ NH-	4-氟苯基	2-氯-5-噻唑基	417
147	-	-CH ₂ -	1,2,4-三唑-1-基	2-氯-5-噻唑基	376.1
148	-	-CH ₂ -	1,2,3-三唑-1-基	2-氯-5-噻唑基	375
149	-	-CH ₂ -	1,2,5-三唑-1-基	2-氯-5-噻唑基	374.9
150	-	-NH-	4-氟苯基	2-氯-5-噻唑基	292
151	-	直接键	3-甲氧基-5-(3-甲基丁氧基)苯基	2-氯-5-噻唑基	486
152	-	直接键	5-丁氧基-3-甲氧基苯基	2-氯-5-噻唑基	472

[0299]

153	-	直接键	3-甲氧基-5-(2-苯基乙氧基)苯基	2-氯-5-噻唑基	520
154	-	直接键	3-甲氧基-5-(2-甲基丙氧基)苯基	2-氯-5-噻唑基	472
155	-	直接键	3-甲氧基-5-(2-甲氧基乙氧基)苯基	2-氯-5-噻唑基	474
156	-	-C(O)-	4-溴-2,6-二氟苯基	2-氯-5-噻唑基	511.9
157	-	-C(O)-	2,4,6-三氟苯基	2-氯-5-噻唑基	452
158	-	-C(O)-	2,6-二氟苯基	2-氯-5-噻唑基	433.9
159	-	-C(O)-	6-溴-2,4-二氟苯基	2-氯-5-噻唑基	511.9

[0300] 本发明的化合物一般会用作组合物(即制剂)中的无脊椎害虫防治活性成分,其中至少一种附加组分选自:表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂,用作载体。选择该制剂或组合物成分,以与活性成分的物理特性、施用模式和环境因素诸如土壤类型、水分和温度一致。

[0301] 有用的制剂包括液体和固体组合物二者。液体组合物包括任选地可以被稠化成凝胶的溶液(包括乳油)、悬浮液、乳液(包括微乳液、水包油乳液、可流动的浓缩物和/或悬浮乳液)等。含水液体组合物的一般类型为可溶性浓缩物、悬浮液浓缩物、胶囊悬浮液、浓缩乳液、微乳液、水包油乳液、可流动的浓缩物和悬浮乳液。非含水液体组合物的一般类型为乳油、微乳油(microemulsifiable concentrate)、可分散的浓缩物和油分散体。

[0302] 固体组合物的一般类型为粉剂、粉末、颗粒剂、球剂、粒料、锭剂、片剂、填充膜(包括种子包衣)等,它们可以是水-可分散的(“可湿性的”)或水-溶性的。由成膜溶液或可流动的悬浮液形成的膜和包衣特别可用于种子处理。活性成分可以被(微)包封并进一步形成为悬浮液或固体制剂;或者,活性成分的整个制剂可以被包封(或“包覆”)。包封可以控制或延缓活性成分的释放。乳粒结合了乳油制剂和干颗粒制剂两者的优点。高强度组合物主要用作进一步制剂的中间体。

[0303] 可喷雾的制剂通常在喷雾之前分散在适宜的介质中。这样的液体和固体制剂被配制成在喷雾介质,通常为水,但偶尔另一种合适介质像芳族烃或石蜡烃或植物油中易于稀释的。喷雾体积可以为每公顷约一至几千升,但更典型为每公顷约十至几百升。可喷雾的制剂可在槽中与水或另一种合适的介质混合,用于通过空气或地面施用来进行叶处理,或用于施用到植物的生长介质中。液体和干制剂可以直接计量加入滴灌系统中,或在种植期间计量加入犁沟中。液体和固体制剂可在种植之前作为种子处理剂施用到作物和其他期望的植被的种子,以便通过内吸吸收来保护发育中的根和其他地面下的植物部分和/或叶。

[0304] 制剂通常会含有总计达100重量百分比的在以下近似范围内的有效量的活性成分、稀释剂和表面活性剂。

		重量百分比		
		活性成分	稀释剂	表面活性剂
	水可分散性和水溶性颗粒剂、片剂和粉末	0.001-90	0-99.999	0-15
[0305]	油分散体、悬浮液、乳液、溶液(包括乳油)	1-50	40-99	0-50
	粉剂	1-25	70-99	0-5
	颗粒剂和球剂	0.001-99	5-99.999	0-15
	高强度组合物	90-99	0-10	0-2

[0306] 固体稀释剂包括,例如,粘土诸如膨润土、蒙脱土、凹凸棒石和高岭土、石膏、纤维素、二氧化钛、氧化锌、淀粉、糊精、糖(例如,乳糖、蔗糖)、二氧化硅、滑石、云母、硅藻土、脲、碳酸钙、碳酸钠和碳酸氢钠、以及硫酸钠。典型的固体稀释剂在Watkins等人的Handbook of Insecticide DustDiluents and Carriers[杀昆虫剂粉剂稀释剂和载体手册],第2版,Dorland Books,考德威尔,新泽西州中有所描述。

[0307] 液体稀释剂包括,例如水、N,N-二甲基烷酰胺(例如,N,N-二甲基甲酰胺)、柠烯、二甲基亚砷、N-烷基吡咯烷酮(例如,N-甲基吡咯烷酮)、磷酸烷基酯(例如,磷酸三乙酯)、乙二醇、三乙二醇、丙二醇、二丙二醇、聚丙二醇、碳酸亚丙酯、碳酸亚丁酯、石蜡(例如白矿物油、正构烷烃、异构烷烃)、烷基苯、烷基萘、甘油、三乙酸甘油酯、山梨醇、芳烃、脱芳构化脂族化合物、烷基苯、烷基萘、酮,诸如环己酮、2-庚酮、异佛尔酮和4-羟基-4-甲基-2-戊酮,乙酸酯,诸如乙酸异戊酯、乙酸己酯、乙酸庚酯、乙酸辛酯、乙酸壬酯、乙酸十三烷基酯和乙酸异冰片酯,其他酯,诸如诸如烷基化乳酸酯、二元酯、苯甲酸烷基和芳基酯、 γ -丁内酯,以及可以是直链、支链、饱和或不饱和的醇,诸如甲醇、乙醇,正丙醇、异丙醇、正丁醇、异丁醇、正己醇、2-乙基己醇、正辛醇、癸醇、异癸醇、异十八烷醇、鲸蜡醇、月桂醇、十三烷醇、油醇、环己醇、四氢糠醇、双丙酮醇、甲酚和苕醇。液体稀释剂还包括饱和的和不饱和的脂肪酸(通常为 C_6 - C_{22})的甘油酯,诸如植物种子和果实油(例如,橄榄油、蓖麻油、亚麻籽油、芝麻油、玉米油(玉蜀黍油)、花生油、葵花籽油、葡萄籽油、红花油、棉籽油、大豆油、油菜籽油、椰子油和棕榈仁油),动物源脂肪(例如,牛脂、猪脂、猪油、鱼肝油、鱼油),以及它们的混合物。液体稀释剂还包括烷基化(例如甲基化、乙基化、丁基化)脂肪酸,其中脂肪酸可以通过来自植物和动物来源的甘油酯的水解获得,并且可通过蒸馏纯化。典型的液体稀释剂在Marsden, Solvents Guide[溶剂指南],第2版,Interscience,纽约,1950中描述。

[0308] 本发明的固体和液体组合物通常包括一种或多种表面活性剂。当添加到液体中时,表面活性剂(surfactant)(也称为“表面活性剂(surface-active agent)”)通常改变、最经常地降低液体的表面张力。根据表面活性剂分子中的亲水和亲脂基团的性质,表面活性剂可用作润湿剂、分散剂、乳化剂或消泡剂。

[0309] 表面活性剂可以分为非离子的、阴离子的或阳离子的。可用于本发明组合物的非离子表面活性剂包括但不限于:醇烷氧基化物,诸如基于天然醇和合成醇(其可以是支链或直链的)并且由醇和环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们的混合物制备的醇烷氧基化物;胺乙氧基化物、烷醇酰胺和乙氧基化烷醇酰胺;烷氧基化甘油三酯,诸如乙氧基化的大豆油、蓖麻油和油菜籽油;烷基酚烷氧基化物,诸如辛基酚乙氧基化物、壬基酚乙氧基化物、二壬基酚乙氧基化物和十二烷基酚乙氧基化物(由苯酚和环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们混合物制备);由环氧乙烷或环氧丙烷制备的嵌段聚合物和其中末端嵌段由环氧丙烷

制备的反式嵌段聚合物;乙氧基化脂肪酸;乙氧基化脂肪酯和油;乙氧基化甲酯;乙氧基化三苯乙烯基酚(包括由环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们的混合物制备的那些);脂肪酸酯、甘油酯、基于羊毛脂的衍生物、聚乙氧基化酯(如聚乙氧基化脱水山梨糖醇脂肪酸酯、聚乙氧基化山梨糖醇脂肪酸酯和聚乙氧基化甘油脂肪酸酯);其他脱水山梨糖醇衍生物如脱水山梨糖醇酯;聚合物表面活性剂,诸如无规共聚物、嵌段共聚物、醇酸peg(聚乙二醇)树脂、接枝或梳型聚合物以及星型聚合物;聚乙二醇(pegs);聚乙二醇脂肪酸酯;硅酮基表面活性剂;和糖衍生物,诸如蔗糖酯、烷基多糖苷和烷基多糖。

[0310] 有用的阴离子表面活性剂包括但不限于:烷基芳基磺酸及其盐;羧化的醇或烷基酚乙氧基化物;二苯基磺酸酯衍生物;木质素和木质素衍生物,诸如木质素磺酸盐;马来酸或琥珀酸或它们的酸酐;烯烴磺酸酯;磷酸酯,诸如醇烷氧基化物的磷酸酯,烷基酚烷氧基化物的磷酸酯和苯乙烯基苯酚乙氧基化物的磷酸酯;基于蛋白质的表面活性剂;肌氨酸衍生物;苯乙烯基苯酚醚硫酸盐;油和脂肪酸的硫酸盐和磺酸盐;乙氧基化烷基酚的硫酸盐和磺酸盐;醇的硫酸盐;乙氧基化醇的硫酸盐;胺和酰胺的磺酸盐,诸如N,N-烷基牛磺酸盐;苯、枯烯、甲苯、二甲苯以及十二烷基苯和十三烷基苯的磺酸盐;缩聚萘的磺酸盐;萘和烷基萘的磺酸盐;馏石油的磺酸盐;磺基琥珀酰胺酸盐;以及磺基琥珀酸盐和它们的衍生物,诸如二烷基磺基琥珀酸盐。

[0311] 有用的阳离子表面活性剂包括但不限于:酰胺和乙氧基化酰胺;胺诸如N-烷基丙二胺、三亚丙基三胺和二亚丙基四胺,和乙氧基化胺、乙氧基化二胺以及丙氧基化胺(由胺和环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们的混合物制备);胺盐如乙酸铵和二胺盐;季铵盐如季盐、乙氧基化季盐和二季盐;以及胺氧化物,诸如烷基二甲基胺氧化物和双-(2-羟乙基)-烷基胺氧化物。

[0312] 还可用于本发明组合物的是非离子表面活性剂和阴离子表面活性剂的混合物、或非离子表面活性剂和阳离子表面活性剂的混合物。非离子表面活性剂、阴离子表面活性剂和阳离子表面活性剂及其推荐用途在多个已公布的参考文献中公开,这些参考文献包括McCutcheon分部,The Manufacturing Confectioner Publishing Co.[糖果制造商出版公司]出版的McCutcheon's Emulsifiers and Detergents[McCutcheon的乳化剂和洗涤剂],annual American and International Editions[美国和国际年度版];Sisely和Wood,Encyclopedia of Surface Active Agents[表面活性剂百科全书],Chemical Publ.Co.,Inc.[化工出版社有限公司],纽约,1964;以及A.S.Davidson和B.Milwidsky,Synthetic Detergents[合成洗涤剂],第七版,约翰威利父子公司,纽约,1987。

[0313] 本发明的组合物还可包含本领域技术人员已知为辅助制剂的制剂助剂和添加剂(其中一些也可被认为是起到固体稀释剂、液体稀释剂或表面活性剂作用)。这样的制剂助剂和添加剂可控制:pH(缓冲剂)、加工过程中的起泡(消泡剂,诸如聚有机硅氧烷)、活性成分的沉降(悬浮剂)、粘度(触变增稠剂)、容器内的微生物生长(抗微生物剂)、产品冷冻(防冻剂)、颜色(染料/颜料分散体)、洗脱(成膜剂或粘着剂)、蒸发(蒸发阻滞剂)、以及其他制剂属性。成膜剂包括例如聚乙酸乙烯酯、聚乙酸乙烯酯共聚物、聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯酯共聚物、聚乙烯醇、聚乙烯醇共聚物和蜡。制剂助剂和添加剂的实例包括由McCutcheon的分部,The Manufacturing Confectioner Publishing Co.出版的McCutcheon的第二卷:Functional Materials[功能材料],国际和北美年度版;以及PCT公布WO 03/024222中列出

的那些。

[0314] 通常通过将活性成分溶于溶剂中或者通过在液体或干稀释剂中研磨将式1的化合物和任何其他活性成分结合到本发明组合物中。可通过简单地混合这些成分来制备包括乳油的溶液。如果旨在用作乳油的液体组合物的溶剂是与水不混溶的,通常加入乳化剂以使含有活性成分的溶剂在用水稀释时乳化。粒径至多2,000 μm 的活性成分浆料可以使用介质研磨机进行湿法研磨,以得到平均粒径低于3 μm 的颗粒。含水浆液可以制成成品悬浮液浓缩物(参见,例如,U.S.3,060,084)或通过喷雾干燥进一步加工以形成水可分散性颗粒剂。干制剂通常需要干研磨过程,其产生2至10 μm 的平均粒径。粉剂和粉末可以通过共混并且通常通过研磨(例如用锤磨机或流能磨)来制备。可通过将活性物质喷雾在预成形的颗粒剂载体上或者通过团聚技术来制备颗粒剂和球剂。参见,Browning,“Agglomeration[团聚]”,Chemical Engineering[化学工程],1967年12月4日,第147-48页;Perry’s Chemical Engineer’s Handbook[佩里化学工程师手册],第4版,McGraw-Hill[麦格劳希尔集团],纽约,1963,第8-57页及其后页,以及W0 91/13546。球剂可以如U.S.4,172,714中所述制备。水-可分散性和水-溶性颗粒剂可如在U.S.4,144,050、U.S.3,920,442和DE 3,246,493中教导的来制备。片剂可以如在U.S.5,180,587,U.S.5,232,701和U.S.5,208,030中所教导的来制备。膜可以如在GB 2,095,558和U.S.3,299,566中所教导的来制备。

[0315] 关于制剂领域的进一步信息,参见T.S.Woods,Pesticide Chemistry and Bioscience,The Food-Environment Challenge[农药化学与生物科学,食品与环境挑战]中的“The Formulator’s Toolbox-Product Forms for Modern Agriculture[制剂工具箱-现代农业产品形式]”,T.Brooks和T.R.Roberts编辑,Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry[第九届农药化学国际会议论文集],The Royal Society of Chemistry[皇家化学学会],剑桥,1999,第120-133页。还参见U.S.3,235,361,第6栏,第16行至第7栏,第19行和实施例10-41;U.S.3,309,192,第5栏,第43行至第7栏,第62行和实施例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138-140、162-164、166、167和169-182;U.S.2,891,855,第3栏,第66行至第5栏,第17行和实施例1-4;Klingman,Weed Control as a Science[杂草控制科学],约翰威利父子公司,纽约,1961,第81-96页;Hance等人,Weed Control Handbook[杂草控制手册],第8版,Blackwell Scientific Publications[布莱克威尔科学出版社],牛津,1989;和Developments in formulation technology[配方技术的发展],PJB出版公司[PJB Publications],里士满,UK,2000。

[0316] 在下列实施例中,所有制剂以常规的方式制备。化合物编号是指索引表A-G中的化合物。无需进一步详尽说明,据信本领域技术人员使用前述说明可将本发明利用至其最大程度。因此,以下实施例应被解释为仅仅是说明性的,并非以任何方式限制本公开。除非另外说明,否则百分比按重量计。

[0317] 实施例A

[0318] 高强度浓缩物

[0319] 化合物3 98.5%

[0320] 二氧化硅气凝胶 0.5%

[0321] 合成无定形精细二氧化硅 1.0%

[0322] 实施例B

[0323]	<u>可湿性的粉末</u>	
	化合物 6	65.0%
	十二烷基苯酚聚乙二醇醚	2.0%
[0324]	木质素磺酸钠	4.0%
	硅铝酸钠	6.0%
	蒙脱土(煅烧的)	23.0%
[0325]	<u>实施例C</u>	
[0326]	<u>颗粒剂</u>	
	化合物 25	10.0%
[0327]	凹凸棒石颗粒剂(低挥发性物质, 0.71/0.30 mm; U.S.S. No.25-50 筛)	90.0%
[0328]	<u>实施例D</u>	
[0329]	<u>挤出球剂</u>	
	化合物 48	25.0%
	无水硫酸钠	10.0%
[0330]	粗木质素磺酸钙	5.0%
	烷基萘磺酸钠	1.0%
	钙/镁膨润土	59.0%
[0331]	<u>实施例E</u>	
[0332]	<u>乳油</u>	
[0333]	化合物57	10.0%
[0334]	聚氧乙烯山梨醇六油酸酯	20.0%
[0335]	C ₆ -C ₁₀ 脂肪酸甲酯	70.0%
[0336]	<u>实施例F</u>	
[0337]	<u>微乳液</u>	
	化合物 72	5.0%
	聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯酯共聚物	30.0%
[0338]	烷基多糖苷	30.0%
	单油酸甘油酯	15.0%
	水	20.0%
[0339]	<u>实施例G</u>	
[0340]	<u>种子处理剂</u>	
	化合物 76	20.00%
	聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯酯共聚物	5.00%
	褐煤酸蜡	5.00%
	木质素磺酸钙	1.00%
[0341]	聚氧乙烯/聚氧丙烯嵌段共聚物	1.00%
	硬脂醇(POE 20)	2.00%
	聚有机硅烷	0.20%
	着色剂红色染料	0.05%
	水	65.75%
[0342]	<u>实施例H</u>	
[0343]	<u>肥料棒</u>	

	化合物 92	2.5%
	吡咯烷酮-苯乙烯共聚物	4.8%
	三苯乙烯基苯基 16-乙氧基化物	2.3%
[0344]	滑石	0.8%
	玉米淀粉	5.0%
	缓释肥料	36.0%
	高岭土	38.0%
	水	10.6%
[0345]	<u>实施例I</u>	
[0346]	<u>悬浮浓缩物</u>	
	化合物 94	35%
	丁基聚氧乙烯/聚丙烯嵌段共聚物	4.0%
[0347]	硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
	苯乙烯丙烯酸聚合物	1.0%
	黄原胶	0.1%
	丙二醇	5.0%
[0348]	基于硅酮的消泡剂	0.1%
	1,2-苯并异噻唑啉-3-酮	0.1%
	水	53.7%
[0349]	<u>实施例J</u>	
[0350]	<u>在水中的乳液</u>	
	化合物 98	10.0%
	丁基聚氧乙烯/聚丙烯嵌段共聚物	4.0%
	硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
	苯乙烯丙烯酸聚合物	1.0%
[0351]	黄原胶	0.1%
	丙二醇	5.0%
	基于硅酮的消泡剂	0.1%
	1,2-苯并异噻唑啉-3-酮	0.1%
	基于芳族石油的烃	20.0
	水	58.7%
[0352]	<u>实施例K</u>	
[0353]	<u>油分散体</u>	
	化合物 121	25%
[0354]	聚氧乙烯山梨醇六油酸酯	15%
	有机改性的膨润土	2.5%
	脂肪酸甲酯	57.5%
[0355]	<u>实施例L</u>	
[0356]	<u>悬浮乳液</u>	

	化合物 127	10.0%
	吡虫啉	5.0%
	丁基聚氧乙烯/聚丙烯嵌段共聚物	4.0%
	硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
	苯乙烯丙烯酸聚合物	1.0%
[0357]	黄原胶	0.1%
	丙二醇	5.0%
	基于硅酮的消泡剂	0.1%
	1,2-苯并异噻唑啉-3-酮	0.1%
	基于芳族石油的烃	20.0%
	水	53.7%

[0358] 本发明的化合物表现出针对广谱的无脊椎害虫的活性。这些害虫包括栖息于各种环境中的无脊椎动物,这些环境是例如像植物叶、根、土壤、收获的作物或其他食物、建筑结构或动物体被。这些害虫包括例如以叶子(包括叶、茎、花和果实)、种子、木材、纺织纤维或动物血液或组织为食,并且从而对例如生长中或储存的农学作物、森林、温室作物、观赏植物、苗圃作物、储存的食品或纤维制品、或房屋或其他结构物或其内容物造成伤害或损害,或对动物健康或公共卫生有害的无脊椎动物。本领域技术人员会理解,并不是所有的化合物对所有害虫的所有生长阶段都同等有效。

[0359] 因此,这些本发明的化合物和组合物在农业上可用于保护大田作物免受植食性无脊椎害虫,并且还非农业地用于保护其他园艺作物和植物免受植食性无脊椎害虫。该效用包括保护含有通过基因工程(即转基因的)引入或者由诱变改性的遗传物质以提供有利的性状的作物和其他植物(即农学和非农学的)。这样的性状的实例包括耐除草剂、耐植食性害虫(例如昆虫、螨、蚜虫、蜘蛛、线虫、蜗牛、植物致病真菌、细菌和病毒)、改进的植物生长、对不良生长条件如高温和低温、高或低的土壤湿度以及高盐度的提高的耐受性、增加的花或结果、更高的收获产量、更快成熟、收获产品的更高质量和/或营养价值、或收获产品的改善的储存或加工特性。转基因植物可以经改性以表达多种性状。含有由基因工程或诱变提供的性状的植物的实例包括表达杀虫苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*)毒素的各种玉米、棉花、大豆和马铃薯如YIELDGARD®、KNOCKOUT®、STARLINK®、BOLLGARD®、NuCOTN®和NEWLEAF®、INVICTARR2 PRO™和耐受除草剂的各种玉米、棉花、大豆和油菜籽如ROUNDUPREADY®、LIBERTYLINK®、IMI®、STS®和CLEARFIELD®,以及表达N-乙酰基转移酶(GAT)以提供对草甘膦除草剂的抗性的作物,或含有提供对抑制乙酰乳酸合酶(ALS)的除草剂的抗性的HRA基因的作物。本发明的化合物和组合物可以与通过基因工程引入或通过诱变改性的性状协同地相互作用,从而增强性状的表型表达或有效性或者提高本发明的化合物和组合物的无脊椎害虫防治有效性。特别地,本发明的化合物和组合物可以与蛋白质或对无脊椎害虫有毒的其他天然产品的表型表达协同地相互作用,以提供对这些害虫的高于加合的防治。

[0360] 本发明的组合物还可以任选地包含植物营养素,例如,包含至少一种选自氮、磷、钾、硫、钙、镁、铁、铜、硼、锰、锌和钼的植物营养素的肥料组合物。值得注意的是包含至少一种肥料组合物的组合物,该肥料组合物包含至少一种选自氮、磷、钾、硫、钙和镁的植物营养素。本发明的进一步包含至少一种植物营养素的组合物可以是呈液体或固体的形式。值得注意的是呈颗粒、小棒或片剂形式的固体制剂。包含肥料组合物的固体制剂可以通过将本

发明的化合物或组合物与该肥料组合物和配制成分一起混合并且然后通过诸如造粒或挤出的方法制备制剂来制备。或者,固体制剂可以通过将本发明的化合物或组合物在挥发性溶剂中的溶液或悬浮液喷雾到以前制备的呈尺寸稳定的混合物形式(例如,颗粒、小棒或片剂)的肥料组合物上,并且然后蒸发溶剂来制备。

[0361] 非农学用途是指除作物植物田地外的区域中的无脊椎害虫防治。本发明的化合物和组合物的非农学用途包括在储存的谷物、豆类和其他食品以及纺织品如衣物和地毯中防治无脊椎害虫。本发明的化合物和组合物的非农学用途还包括在观赏植物、森林、院落、路边和铁路用地、以及草皮如草坪、高尔夫球场和牧场中的无脊椎害虫防治。本发明的化合物和组合物的非农学用途还包括在房屋和可能被人类和/或同伴、农场、牧场、动物园或其他动物占据的其他建筑物中的无脊椎害虫防治。本发明的化合物和组合物的非农学用途还包括可能损害建筑物中使用的木材或其他结构材料的害虫诸如白蚁的防治。

[0362] 本发明的化合物和组合物的非农学用途还包括通过防治寄生的或传播传染性疾病的无脊椎害虫来保护人和动物健康。对动物寄生虫的防治包括防治寄生于宿主动物身体表面(例如,肩部、腋窝、腹部、大腿内侧)的外部寄生虫和寄生于宿主动物身体内部(例如,胃、肠、肺、静脉、皮下、淋巴组织)的内部寄生虫。外部寄生虫或传播疾病的害虫包括,例如,恙螨、蜱、虱、蚊子、蝇、螨虫和跳蚤。内部寄生虫包括犬恶丝虫、钩虫和蠕虫。本发明的化合物和组合物适用于内吸和/或非内吸防治动物上寄生虫的侵袭或者感染。本发明的化合物和组合物特别适用于对抗外部寄生虫或传播疾病的害虫。本发明的化合物和组合物适用于对抗侵袭农业工作动物如牛、绵羊、山羊、马、猪、驴、骆驼、水牛、兔、母鸡、火鸡、鸭、鹅和蜜蜂;宠物动物和家畜如狗、猫、宠物鸟和观赏鱼;以及所谓的实验动物如仓鼠、豚鼠、大鼠和小鼠的寄生虫。通过对抗这些寄生虫,降低了死亡率和性能下降(在肉、奶、羊毛、皮肤、蛋、蜂蜜等方面),因此施用包含本发明的化合物的组合物允许更经济且简单地饲养动物。

[0363] 农学或非农学无脊椎害虫的实例包括鳞翅目的卵、幼虫和成虫,如夜蛾科的粘虫、地老虎、尺蠖和棉铃虫(heliothines)(例如,粉色蛀茎虫(pink stem borer)(大螟(*Sesamia inferens* Walker))、玉米钻心虫(corn stalk borer)(*Sesamia nonagrioides* Lefebvre)、南方粘虫(southern armyworm)(南方灰翅夜蛾(*Spodoptera eridania* Cramer))、秋夜蛾(fall armyworm)(草地贪夜蛾(*Spodoptera frugiperda* J.E.Smith))、甜菜夜蛾(beet armyworm)(甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua* Hübner))、棉叶虫(cotton leafworm)(海灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis* Boisduval))、黄条粘虫(yellowstriped armyworm)(*Spodoptera ornithogalli* Guenée)、小地老虎(black cutworm)(小地老虎(*Agrotis ipsilon* Hufnagel))、velvetbean caterpillar(藜豆夜蛾(*Anticarsia gemmatilis* Hübner))、绿果夜蛾(green fruitworm)(绿果冬夜蛾(*Lithophane antennata* Walker))、甘蓝夜蛾(cabbage armyworm)(甘蓝夜蛾(*Barathra brassicae* Linnaeus))、大豆尺蠖(soybean looper)(大豆尺蠖(*Pseudoplusia includens* Walker))、粉纹夜蛾(cabbage looper)(粉纹夜蛾(*Trichoplusia ni* Hübner))、烟青虫(tobacco budworm)(烟芽夜蛾(*Heliothis virescens* Fabricius));来自螟蛾科的螟虫、鞘蛾、结网虫、coneworms、甘蓝虫和雕叶虫(skeletonizers)(例如,欧洲玉米螟(European corn borer)(玉米螟(*Ostrinia nubilalis* Hübner))、脐橙螟(navel orangeworm)(*Amyelois transitella* Walker))、玉米根结网虫(corn root webworm)(玉米根草螟(*Crambus*

caliginosellus Clemens))、草地螟(sod webworms) (螟蛾科:草螟亚科) 如草地螟(sod worm) (水稻切叶野螟(Herpetogramma licarsialis Walker))、甘蔗二点螟(sugarcane stem borer) (粟灰螟(Chilo infuscatellus Snellen))、小番茄蛀虫(tomato small borer) (Neoleucinodes elegantalis Guenée)、绿卷叶螟(green leafroller) (稻纵卷叶螟(Cnaphalocrocis medinalis))、葡萄卷叶虫(grape leafroller) (葡萄卷叶虫(Desmia funeralis Hübner))、甜瓜野螟(melon worm) (瓜绢野螟(Diaphania nitidalis Stoll))、甘蓝芯蛱蝶(cabbage center grub) (Helluala hydralis Guenée)、水稻三化螟(yellow stem borer) (三化螟(Scirpophaga incertulas Walker))、早期嫩梢蛀虫(early shoot borer) (蔗螟(Scirpophaga infuscatellus Snellen))、白色蛀茎虫(white stem borer) (稻白螟(Scirpophaga innotata Walker))、顶部嫩梢蛀虫(top shoot borer) (甘蔗白螟(Scirpophaga nivella Fabricius))、黑头稻螟(dark-headed rice borer) (Chilo polychrysus Meyrick)、条纹稻螟(striped riceborer) (二化螟(Chilo suppressalis Walker))、卷心菜丛毛虫(cabbage cluster caterpillar) (英国大菜螟(Crocicidolomia binotalis English));卷蛾科的卷叶虫、蛱虫、种实虫和果实虫(例如,苹果蠹蛾(codling moth) (苹果蠹蛾(Cydia pomonella Linnaeus))、葡萄小卷叶蛾(grape berry moth) (葡萄果实虫主虫(Endopiza viteana Clemens))、梨小食心虫(oriental fruit moth) (东方果实蛾(Grapholita molesta Busck))、柑橘假苹果蠹蛾(citrus false codling moth) (苹果异形小卷蛾(Cryptophlebia leucotreta Meyrick))、柑橘天牛(citrus borer) (Ecdytolopha aurantiana Lima)、红带卷叶蛾(redbanded leafroller) (红带卷蛾(Argyrotaenia velutinana Walker))、斜带卷叶蛾(obliquebanded leafroller) (蔷薇斜条卷叶蛾(Choristoneura rosaceana Harris))、苹果浅褐卷叶蛾(light brown apple moth) (苹果浅褐卷蛾(Epiphyas postvittana Walker))、欧洲葡萄小卷叶蛾(European grape berry moth) (女贞细卷蛾(Eupoecilia ambiguella Hübner))、苹果顶芽卷叶蛾(apple bud moth) (苹果顶芽卷叶蛾(Pandemis pyrusana Kearfott))、杂食性卷叶蛾(omnivorous leafroller) (杂食性卷叶蛾(Platynota stultana Walsingham))、葡萄褐卷蛾(barred fruit-tree tortrix) (葡萄褐卷蛾(Pandemis cerasana Hübner))、苹果褐卷叶蛾(apple brown tortrix) (苹果褐卷蛾(Pandemis heparana Denis&Schiffermüller));和许多其他经济上重要的鳞翅目(例如,小菜蛾(diamondback moth) (小菜蛾(Plutella xylostella Linnaeus))、棉红铃虫(pink bollworm) (棉红铃虫(Pectinophora gossypiella Saunders))、舞毒蛾(gypsy moth) (舞毒蛾(Lymantria dispar Linnaeus))、桃小食心虫(peach fruit borer) (桃小食心虫(Carposina niponensis Walsingham))、桃条麦蛾(peach twig borer) (桃条麦蛾(Anarsia lineatella Zeller))、马铃薯块茎蛾(potato tuberworm) (马铃薯块茎蛾(Phthorimaea operculella Zeller))、斑点缘虫状潜叶蛾(spotted teniform leafminer) (斑幕潜叶蛾(Lithocolletis blancardella Fabricius))、苹果金纹细蛾(Asiatic apple leafminer) (金纹细蛾(Lithocolletis ringoniella Matsumura))、稻纵卷叶螟(rice leafroller) (稻纵卷叶螟(Lerodea eufala Edwards))、旋纹潜叶蛾(apple leafminer) (旋纹潜叶蛾(Leucoptera scitella Zeller));蜚蠊目的卵、若虫和成虫,包括来自姬蜚蠊科和蜚蠊科的蟑螂(例如,东方蟑螂(oriental cockroach) (东方蟑螂(Blatta orientalis Linnaeus))、亚洲蟑螂(Asian

cockroach) (*Blattella asahinai* Mizukubo)、德国蟑螂 (German cockroach) (德国小蠊 (*Blattella germanica* Linnaeus))、褐色带蟑螂 (brownbanded cockroach) (褐带皮蠊 (*Supella longipalpa* Fabricius))、美洲蟑螂 (American cockroach) (美洲大蠊 (*Periplaneta americana* Linnaeus))、褐色蟑螂 (brown cockroach) (褐色大蠊 (*Periplaneta brunnea* Burmeister))、马德拉蟑螂 (Madeira cockroach) (马德拉蜚蠊 (*Leucophaea maderae* Fabricius))、黑胸大蠊 (smoky brown cockroach) (黑胸大蠊 (*Periplaneta fuliginosa* Service))、澳洲蟑螂 (Australian Cockroach) (澳洲蟑螂 (*Periplaneta australasiae* Fabr.))、龙虾蟑螂 (lobster cockroach) (灰色蟑螂 (*Nauphoeta cinerea* Olivier)) 和光滑蟑螂 (smooth cockroach) (淡色歪尾蠊 (*Symploce pallens* Stephens)); 鞘翅目的卵, 叶子取食、果实取食、根取食、种子取食和囊泡组织取食的幼虫和成虫, 包括来自长角象虫科 (Anthribidae)、豆象科 (Bruchidae) 和象鼻虫科 (Curculionidae) 的象鼻虫 (例如, 棉铃象虫 (boll weevil) (墨西哥棉铃象 (*Anthonomus grandis* Boheman))、稻水象虫 (rice water weevil) (稻水象甲 (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel))、谷象 (granary weevil) (谷象 (*Sitophilus granarius* Linnaeus))、米象 (rice weevil) (米象 (*Sitophilus oryzae* Linnaeus))、早熟禾象鼻虫 (annual bluegrass weevil) (早熟禾象鼻虫 (*Listronotus maculicollis* Dietz))、早熟禾谷象甲 (bluegrass billbug) (牧草长喙象 (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal))、狩猎谷象 (hunting billbug) (猎长喙象 (*Sphenophorus venatus vestitus*))、丹佛谷象 (Denver billbug) (丹佛长喙象 (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); 叶甲科 (Chrysomelidae) 的跳甲、黄瓜叶甲、根虫、叶甲、马铃薯甲虫和潜叶虫 (例如, 科罗拉多马铃薯甲虫 (Colorado potato beetle) (马铃薯甲虫 (*Leptinotarsa decemlineata* Say))、西部玉米根虫 (western corn rootworm) (西方玉米根虫 (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); 来自金龟子科的金龟子和其他甲虫 (例如, 日本丽金龟 (Japanese beetle) (日本丽金龟 (*Popillia japonica* Newman))、东方丽金龟 (oriental beetle) (东方丽金龟 (*Anomala orientalis* Waterhouse, *Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud))、北方独角仙 (northern masked chafer) (北方圆头犀金龟 (*Cyclocephala borealis* Arrow))、南方独角仙 (southern masked chafer) (南方圆头犀金龟 (*Cyclocephala immaculata* Olivier 或 *C. lurida* Bland))、蜣螂 (dung beetle) 和白蛴 (white grub) (蜉金龟属 (*Aphodius*) 物种)、草皮黑金龟 (black turfgrass ataenius) (草皮黑金龟 (*Ataenius spretulus* Haldeman))、绿色六月金龟 (green June beetle) (绿花金龟 (*Cotinis nitida* Linnaeus))、亚洲花园甲虫 (Asiatic garden beetle) (紫绒鳃角金龟 (*Maladera castanea* Arrow))、五月/六月鳃金龟 (May/June beetles) (鳃角金龟属 (*Phyllophaga*) 物种) 和欧洲金龟子 (European chafer) (欧洲切根鳃金龟 (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); 来自皮蠹科的皮蠹; 来自叩头甲科的金针虫; 来自小蠹科 (Scolytidae) 的树皮甲虫和来自拟步甲科 (Tenebrionidae) 的面粉甲虫。

[0364] 此外, 农学和非农学害虫包括: 革翅目的卵、成虫和幼虫, 包括来自蠼螋科的蠼螋 (例如, 欧洲蠼螋 (European earwig) (地蜈蚣 (*Forficula auricularia* Linnaeus))、黑蠼螋 (black earwig) (黑蠼螋 (*Chelisoches morio* Fabricius)); 半翅目和同翅目的卵、幼虫、成虫和若虫, 如来自盲蝽科的盲蝽 (plant bugs), 来自蝉科的蝉, 来自大叶蝉科的叶蝉

(leafhoppers) (例如,小绿叶蝉属(*Empoasca*) 物种),来自臭虫科的臭虫(例如,温带臭虫(*Cimex lectularius* Linnaeus)),来自蜡蝉科和飞虱科的飞虱,来自角蝉科的角蝉,来自木虱科的木虱,来自粉虱科的粉虱,来自蚜科的蚜虫,来自根瘤蚜科的根瘤蚜,来自粉蚧科的粉蚧,来自蚧科、盾蚧科和绵蚧科的介壳虫(scales),来自网蝽科的网蝽,来自蝽科的蝽象,来自长蝽科的长蝽(chinch bugs) (例如,毛长蝽(hairy chinch bug) (美洲毛谷长蝽(*Blissus leucopterus hirtus* Montandon)) 和南部麦长蝽(southern chinch bug) (南部麦长蝽(*Blissus insularis* Barber)) 和其他来自长蝽科的长蝽(seed bugs),来自沫蝉科的沫蝉,来自缘蝽科的南瓜缘蝽,以及来自红蝽科的红蝽(red bugs) 和污棉虫(cotton stainers)。

[0365] 农学和非农学害虫还包括:蜱螨目(螨)的卵、幼虫、若虫和成虫,如叶螨科的叶螨(spider mites) 和红螨(例如,欧洲红螨(European red mite) (苹果全爪螨(*Panonychus ulmi* Koch))、两点叶螨(two spotted spider mite) (二斑叶螨(*Tetranychus urticae* Koch))、迈叶螨(McDaniel mite) (迈叶螨(*Tetranychus mcdanieli* McGregor));细须螨科中的短须螨(flat mites) (例如,葡萄短须螨(citrus flat mite) (刘氏短须螨(*Brevipalpus lewisi* McGregor));瘿螨科中的锈螨和蚜螨,和其他叶子取食的螨虫和在人类和动物健康方面有重要影响的螨虫,即表皮螨科(Epidermoptidae) 中的尘螨、蠕形螨科(Demodicidae) 中的毛囊螨、食甜螨科(Glycyphagidae) 中的谷螨;硬蜱科的蜱,通常称为硬蜱(例如,鹿蜱(deer tick) (黑脚硬蜱(*Ixodes scapularis* Say))、澳大利亚致瘫痪蜱(Australian paralysis tick) (全环硬蜱(*Ixodes holocyclus* Neumann))、美洲犬蜱(American dog tick) (变异矩头蜱(*Dermacentor variabilis* Say))、孤星蜱(lone star tick) (美洲钝眼蜱(*Amblyomma americanum* Linnaeus)) 和隐喙蜱科的蜱,通常被称为软蜱(例如,回归热蜱(relapsing fever tick) (回归热钝缘蜱(*Ornithodoros turicata*))、常见鸡蜱(common fowl tick) (常见鸡蜱(*Argas radiatus*));在痒螨科、蒲螨科和疥螨科中的疥螨(scab mites) 和痒螨(itch mites);直翅目的卵、成虫和幼虫,包括蚱蜢、蝗虫和蟋蟀(例如,迁徙蚱蜢(migratory grasshoppers) (例如,血黑蝗(*Melanoplus sanguinipes* Fabricius)、殊种蝗(*M.differentialis* Thomas)、美洲蚱蜢(American grasshoppers) (例如,美洲沙漠蝗(*Schistocerca americana* Drury))、沙漠蝗(desert locust) (沙漠蝗(*Schistocerca gregaria* Forskal))、飞蝗(migratory locust) (飞蝗(*Locusta migratoria* Linnaeus))、灌木蝗(bush locust) (腺蝗属(*Zonocerus*) 物种)、家蟋(house cricket) (家蟋(*Acheta domesticus* Linnaeus))、蝼蛄(mole crickets) (例如,黄褐色蝼蛄(tawny mole cricket) (黄褐色蝼蛄(*Scapteriscus vicinus* Scudder)) 和南美蝼蛄(southern mole cricket) (南美蝼蛄(*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos));双翅目的卵、成虫和幼虫,包括潜叶虫(例如,斑潜蝇属(*Liriomyza*) 物种,如蔬菜斑潜蝇(serpentine vegetable leafminer) (美洲斑潜蝇(*Liriomyza sativae* Blanchard))、蠅(midges)、果蝇(fruit flies) (实蝇科(Tephritidae))、麦秆蝇(frit flies) (例如,瑞典麦秆蝇(*Oscinella frit* Linnaeus))、土壤蛆(soil maggots)、家蝇(house flies) (例如,家蝇(*Musca domestica* Linnaeus))、小家蝇(lesser house flies) (例如,夏厕蝇(*Fannia canicularis* Linnaeus)、小舍蝇(*F.femoralis* Stein))、厩螯蝇(stable flies) (例如,厩螯蝇(*Stomoxys calcitrans* Linnaeus))、秋家蝇(face flies)、角蝇(horn flies)、丽蝇

(blow flies) (例如,金蝇属(*Chrysomya*)物种、伏蝇属(*Phormia*)物种)以及其他蝇类害虫、马蝇(horse flies) (例如,虻属(*Tabanus*)物种)、肤蝇(bot flies) (例如,胃蝇属(*Gastrophilus*)物种,狂蝇属(*Oestrus*)物种)、纹皮蝇(cattle grubs) (例如,牛皮蝇属(*Hypoderma*)物种)、鹿虻(deer flies) (例如,斑虻属(*Chrysops*)物种)、绵羊蜱(keds) (例如,绵羊虱蝇(*Melophagus ovinus* Linnaeus))以及其他短角亚目(*Brachycera*)、蚊子(例如,伊蚊属(*Aedes*)物种、按蚊属(*Anopheles*)物种、库蚊属(*Culex*)物种)、蚋(black flies) (例如,原蚋属(*Prosimulium*)物种、蚋属(*Simulium*)物种)、叮咬蠓(biting midges)、沙蝇(sand flies)、眼菌蚊(sciarids)以及其他长角亚目(*Nematocera*);缨翅目的卵、成虫、和幼虫,包括葱蓟马(onion thrips) (棉蓟马(*Thrips tabaci* Lindeman))、花蓟马(flower thrips) (花蓟马属(*Frankliniella*)物种)、以及其他叶子取食的蓟马;膜翅目的昆虫害虫,包括蚁科的蚂蚁,包括佛罗里达木蚁(the Florida carpenter ant) (佛罗里达弓背蚁(*Camponotus floridanus* Buckley))、红木蚁(red carpenter ant) (红木蚁(*Camponotus ferrugineus* Fabricius))、黑木蚁(black carpenter ant) (黑木蚁(*Camponotus pennsylvanicus* De Geer))、白足蚁(white-footed ant) (白足蚁(*Technomyrmex albipes* fr.Smith))、大头蚁(big headed ants) (大头蚁属(*Pheidole*)物种)、幽灵蚁(ghost ant) (黑头酸臭蚁(*Tapinoma melanocephalum* Fabricius));法老蚁(Pharaoh ant) (小黄家蚁(*Monomorium pharaonis* Linnaeus))、小火蚁(little fire ant) (小火蚁(*Wasmannia auropunctata* Roger))、火蚁(fire ant) (火蚁(*Solenopsis geminata* Fabricius))、红火蚁(red imported fire ant) (红火蚁(*Solenopsis invicta* Buren))、阿根廷蚁(Argentine ant) (阿根廷蚁(*Iridomyrmex humilis* Mayr))、疯蚁(crazy ant) (长角立毛蚁(*Paratrechina longicornis* Latreille))、铺道蚁(pavement ant) (草地铺道蚁(*Tetramorium caespitum* Linnaeus))、玉米田蚁(cornfield ant) (玉米田蚁(*Lasius alienus* Förster))和香家蚁(odorous house ant) (家蚁(*Tapinoma sessile* Say))。其他膜翅目,包括蜂(包括木蜂(car Carpenter bees))、大黄蜂(hornets)、小黄蜂(yellow jackets)、胡蜂(wasps)和叶蜂(sawflies) (新松叶蜂属(*Neodiprion*)物种);茎蜂属(*Cephus*)物种);等翅目的昆虫害虫,包括白蚁科(Termitidae) (例如,大白蚁属(*Macrotermes*)物种,土白蚁(*Odontotermes obesus* Rambur))、木白蚁科(*Kalotermitidae*) (例如,堆砂白蚁属(*Cryptotermes*)物种)、以及鼻白蚁科(*Rhinotermitidae*) (例如,散白蚁属(*Reticulitermes*)物种,乳白蚁属(*Coptotermes*)物种,异白蚁属(*Heterotermes tenuis* Hagen))家族、东部地下白蚁(the eastern subterranean termite) (木食性散白蚁(*Reticulitermes flavipes* Kollar))、西部地下白蚁(western subterranean termite) (西方散白蚁(*Reticulitermes hesperus* Banks))、台湾乳白蚁(Formosan subterranean termite) (家白蚁(*Coptotermes formosanus* Shiraki))、西印度干木白蚁(West Indian drywood termite) (*Incisitermes immigrans* Snyder)、粉白蚁(powder post termite) (麻头砂白蚁(*Cryptotermes brevis* Walker))、干木白蚁(drywood termite) (斯氏楹白蚁(*Incisitermes snyderi* Light))、东南部地下白蚁(southeastern subterranean termite) (美小黑散白蚁(*Reticulitermes virginicus* Banks))、西部干木白蚁(western drywood termite) (西部干木白蚁(*Incisitermes minor* Hagen))、树栖白蚁(arboreal termites) 如象白蚁属(*Nasutitermes*)物种的白蚁以及其他具有经济意义的白蚁;缨尾目

的昆虫害虫,如蠹虫(silverfish)(衣鱼(*Lepisma saccharina* Linnaeus))和家衣鱼(firebrat)(家衣鱼(*Thermobia domestica* Packard));食毛目的昆虫害虫,包括头虱(head louse)(头虱(*Pediculus humanus capitis* De Geer))、体虱(body louse)(体虱(*Pediculus humanus* Linnaeus))、鸡体虱(chicken body louse)(*Menacanthus stramineus* Nitschz)、狗啮毛虱(dog biting louse)(犬毛虱(*Trichodectes canis* De Geer))、绒毛虱(fluff louse)(绒毛虱(*Goniocotes gallinae* De Geer))、羊体虱(sheep body louse)(羊虱(*Bovicola ovis* Schrank))、短鼻牛虱(short-nosed cattle louse)(牛血虱(*Haematopinus eurysternus* Nitzsch))、长鼻牛虱(long-nosed cattle louse)(牛颚虱(*Linognathus vituli* Linnaeus))及其他攻击人和动物的吸吮和嚼咬型寄生虱;蚤目(Siphonoptera)的昆虫害虫,包括东方鼠蚤(the oriental rat flea)(印鼠客蚤(*Xenopsylla cheopis* Rothschild))、猫蚤(cat flea)(猫栳头蚤(*Ctenocephalides felis* Bouche))、犬蚤(dog flea)(犬栳首蚤(*Ctenocephalides canis* Curtis))、鸡蚤(hen flea)(鸡角叶蚤(*Ceratophyllus gallinae* Schrank))、吸着蚤(sticktight flea)(禽角头蚤(*Echidnophaga gallinacea* Westwood))、人蚤(human flea)(人蚤(*Pulex irritans* Linnaeus))以及折磨哺乳动物和禽类的其他跳蚤。所覆盖的另外节肢动物害虫包括:蜘蛛目的蜘蛛,如棕色遁蛛(the brown recluse spider)(棕隐士蛛(*Loxosceles reclusa* Gertsch&Mulaik))和黑寡妇毒蛛(the black widow spider)(黑寡妇毒蛛(*Latrodectus mactans* Fabricius)),以及蚰蜒目的蜈蚣,如蚰蜒(the house centipede)(蚰蜒(*Scutigera coleoptrata* Linnaeus))。

[0366] 存储谷物中的无脊椎害虫的实例包括平截长蠹(larger grain borer)(大谷蠹(*Prostephanus truncatus*))、谷蠹(lesser grain borer)(谷蠹(*Rhyzopertha dominica*))、米象(rice weevil)(米象(*Stiophilus oryzae*))、玉米象(maize weevil)(玉米象(*Stiophilus zeamais*))、豆象(cowpea weevil)(四纹豆象(*Callosobruchus maculatus*))、赤拟谷盗(red flour beetle)(赤拟谷盗(*Tribolium castaneum*))、谷象(granary weevil)(*Stiophilus granarius*)、印度谷螟(Indian meal moth)(印度谷螟(*Plodia interpunctella*))、地中海面粉甲虫(Mediterranean flour beetle)(地中海粉螟(*Ephestia kuehniella*))和长角扁谷盗或锈扁谷盗(flat or rusty grain beetle)(锈赤扁谷盗(*Cryptolestis ferrugineus*))。

[0367] 本发明的化合物可以具有针对线虫纲(Nematoda)、绦虫纲(Cestoda)、吸虫纲(Trematoda)和棘头纲(Acanthocephala)的成员的活性,包括经济上重要的圆线虫目(Strongylida)、蛔目(Ascaridida)、尖尾目(Oxyurida)、小杆目(Rhabditida)、旋尾目(Spirurida)和嘴刺目(Enoplida)的成员,例如但不限于经济上重要的农业害虫(即,根结线虫属(Meloidogync)中的根结线虫(root knot nematodes)、短体线虫属(Pratylenchus)中的根腐线虫(lesion nematodes)、毛刺线虫属(Trichodorus)中的粗短根线虫(stubby root nematodes)等)以及动物和人类健康害虫(即,所有经济上重要的吸虫、绦虫和蛔虫,如马中的寻常圆线虫(*Strongylus vulgaris*)、犬中的犬弓蛔虫(*Toxocara canis*)、羊中的捻转血矛线虫(*Haemonchus contortus*)、犬中的犬恶丝虫(*Dirofilaria immitis* Leidy)、马中的叶状裸头绦虫(*Anoplocephala perfoliata*)、反刍动物中的肝片吸虫(*Fasciola hepatica* Linnaeus)等)。

[0368] 本发明的化合物可以具有针对鳞翅目中的害虫的活性(例如,棉叶波纹夜蛾(*Alabama argillacea* Hübner)(棉叶虫(cotton leaf worm))、果树黄卷蛾(*Archips argyrospila* Walker)(果树卷叶蛾(fruit tree leaf roller))、*A.rosana* Linnaeus(欧洲卷叶蛾(European leaf roller))以及其他黄卷蛾属(*Archips*)物种、二化螟(*Chilo suppressalis* Walker)(稻螟(rice stem borer))、稻纵卷叶螟(*Cnaphalocrosis medinalis* Guenée)(稻纵卷叶螟(rice leaf roller))、玉米根草螟(*Crambus caliginosellus* Clemens)(玉米根结网虫(corn root webworm))、早熟禾草螟(*Crambus teterrellus* Zincken)(早熟禾草螟(bluegrass webworm))、苹果蠹蛾(*Cydia pomonella* Linnaeus)(苹果蠹蛾(codling moth))、棉斑实蛾(*Earias insulana* Boisduval)(多刺螟蛉虫(spiny bollworm))、翠纹钻夜蛾(*Earias vittella* Fabricius)(斑点螟蛉虫(spotted bollworm))、棉铃虫(*Helicoverpa armigera* Hübner)(美洲螟蛉虫(American bollworm))、谷实夜蛾(*Helicoverpa zea* Boddie)(玉米穗蛾(corn earworm))、烟芽夜蛾(*Heliothis virescens* Fabricius)(烟青虫(tobacco budworm))、*Herpetogramma licarsisalis* Walker(草地螟(sod webworm)、葡萄花翅小卷蛾(*Lobesia botrana* Denis&Schiffermüller)(葡萄小卷叶蛾(grape berry moth))、棉红铃虫(*Pectinophora gossypiella* Saunders)(棉红铃虫(pink bollworm))、柑橘潜叶蛾(*Phyllocnistis citrella* Stainton)(柑橘潜叶蛾(citrus leafminer))、大菜粉蝶(*Pieris brassicae* Linnaeus)(大白粉蝶(large white butterfly))、小菜粉蝶(*Pieris rapae* Linnaeus)(小白粉蝶(small white butterfly))、小菜蛾(*Plutella xylostella* Linnaeus)(小菜蛾(diamondback moth))、甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua* Hübner)(甜菜夜蛾(beet armyworm))、斜纹夜蛾(*Spodoptera litura* Fabricius)(斜纹夜蛾(tobacco cutworm, cluster caterpillar))、草地贪夜蛾(*Spodoptera frugiperda* J.E.Smith)(秋夜蛾(fall armyworm))、粉纹夜蛾(*Trichoplusia ni* Hübner)(粉纹夜蛾(cabbage looper)和番茄斑潜蝇(*Tuta absoluta* Meyrick)(番茄斑潜蝇(tomato leafminer))。

[0369] 本发明的化合物对来自同翅目的成员具有显著的活性,包括:豌豆蚜(*Acyrtosiphon pisum* Harris)(豌豆蚜(pea aphid))、黑豆蚜(*Aphis craccivora* Koch)(豆蚜虫(cowpea aphid))、甜菜蚜(*Aphis fabae* Scopoli)(蚕豆蚜(black bean aphid))、棉蚜(*Aphis gossypii* Glover)(棉蚜(cotton aphid, melon aphid))、苹果蚜(*Aphis pomi* De Geer)(苹果蚜(apple aphid))、梨绿蚜虫(*Aphis spiraecola* Patch)(绣线菊蚜(spirea aphid))、茄沟无网蚜(*Aulacorthum solani* Kaltenbach)(毛地黄蚜(foxglove aphid))、草莓蚜(*Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell)(草莓蚜(strawberry aphid))、麦双尾蚜(*Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko)(俄罗斯小麦蚜虫(Russian wheat aphid))、车前圆尾蚜(*Dysaphis plantaginea* Paaserini)(红苹果蚜(rosy apple aphid))、苹果绵蚜(*Eriosoma lanigerum* Hausmann)(苹果绵蚜(woolly apple aphid))、桃大尾蚜(*Hyalopterus pruni* Geoffroy)(桃大尾蚜(mealy plum aphid))、萝卜蚜(*Lipaphis erysimi* Kaltenbach)(萝卜蚜(turnip aphid))、麦无网长管蚜(*Metopolophium dirrhodum* Walker)(麦蚜(cereal aphid))、马铃薯长管蚜(*Macrosiphum euphorbiae* Thomas)(马铃薯蚜(potato aphid))、桃蚜(*Myzus persicae* Sulzer)(桃蚜(peach-potato aphid, green peach aphid))、莠苣蚜(*Nasonovia ribisnigri* Mosley)

(莴苣蚜 (lettuce aphid))、瘿绵蚜属 (*Pemphigus*) 物种 (根蚜 (root aphids) 和倍蚜 (gall aphids))、玉米蚜 (*Rhopalosiphum maidis* Fitch) (玉米蚜 (corn leaf aphid))、禾谷缢管蚜 (*Rhopalosiphum padi* Linnaeus) (禾谷缢管蚜 (bird cherry-oat aphid))、麦二叉蚜 (*Sehizaphis graminum* Rondani) (麦二叉蚜 (greenbug))、麦长管蚜 (*Sitobion avenae* Fabricius) (麦长管蚜 (English grain aphid))、苜蓿斑蚜 (*Therioaphis maculata* Buckton) (苜蓿斑蚜 (spotted alfalfa aphid))、橘二叉蚜 (*Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe) (橘二叉蚜 (black citrus aphid)) 和褐色橘蚜 (*Toxoptera citricida* Kirkaldy) (褐色桔蚜 (brown citrus aphid)); 球属 (*Adelges*) 物种 (球蚜 (adelgids)); 长山核桃根瘤蚜 (*Phylloxera devastatrix* Pergande) (山胡桃根瘤蚜 (pecan phylloxera)); 烟粉虱 (*Bemisia tabaci* Gennadius) (烟粉虱 (tobacco whitefly))、甘薯粉虱 (sweetpotato whitefly)、银叶粉虱 (*Bemisia argentifolii* Bellows&Perring) (银叶粉虱 (silverleaf whitefly))、柑橘粉虱 (*Dialeurodes citri* Ashmead) (柑橘粉虱 (citrus whitefly)) 和温室粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum* Westwood) (温室粉虱 (greenhouse whitefly)); 马铃薯小绿叶蝉 (*Empoasca fabae* Harris) (马铃薯叶蝉 (potato leafhopper))、灰飞虱 (*Laodelphax striatellus* Fallen) (小褐飞虱 (smaller brown planthopper))、二点叶蝉 (*Macrolestes quadrilineatus* Forbes) (紫菀叶蝉 (aster leafhopper))、黑尾叶蝉 (*Nephotettix cincticeps* Uhler) (绿叶蝉 (green leafhopper))、二条黑尾叶蝉 (*Nephotettix nigropictus* Stål) (稻叶蝉 (rice leafhopper))、褐飞虱 (*Nilaparvata lugens* Stål) (褐飞虱 (brown planthopper))、玉米蜡蝉 (*Peregrinus maidis* Ashmead) (玉米飞虱 (corn planthopper))、白背飞虱 (*Sogatella furcifera* Horvath) (白背飞虱 (white-backed planthopper))、稻飞虱 (*Sogatodes orizicola* Muir) (稻飞虱 (rice delphacid))、苹果白叶蝉 (*Typhlocyba pomaria* McAtee) (苹白小叶蝉 (white apple leafhopper))、葡萄斑叶蝉属 (*Erythroneoura*) 物种 (葡萄叶蝉 (grape leafhoppers)); 十七年蝉 (*Magicidada septendecim* Linnaeus) (周期蝉 (periodical cicada)); 吹绵蚧 (*Icerya purchasi* Maskell) (吹绵蚧 (cottony cushion scale))、梨圆蚧 (*Quadraspidiotus perniciosus* Comstock) (梨圆蚧 (San Jose scale)); 臀纹粉蚧 (*Planococcus citri* Risso) (桔粉蚧 (citrus mealybug)); 粉蚧属 (*Pseudococcus*) 物种 (其他粉蚧系群); 梨木虱 (*Cacopsylla pyricola* Foerster) (梨木虱 (pear psylla))、柿木虱 (*Trioza diospyri* Ashmead) (柿木虱 (persimmon psylla))。

[0370] 本发明的化合物还对来自半翅目的成员具有活性, 这些成员包括: 拟绿蝽 (*Acrosternum hilare* Say) (稻绿蝽 (green stink bug))、南瓜缘蝽 (*Anasa tristis* De Geer) (南瓜虫 (squash bug))、美洲谷长蝽 (*Blissus leucopterus leucopterus* Say) (麦长蝽 (chinch bug))、温带臭虫 (*Cimex lectularius* Linnaeus) (臭虫 (bed bug))、方翅网蝽 (*Corythuca gossypii* Fabricius) (棉网蝽 (cotton lace bug))、番茄蝽 (*Cyrtopeltis modesta* Distant) (番茄蝽 (tomato bug))、棉黑翅红蝽 (*Dvsercus suturellus* Herrich-Schäffer) (棉红蝽 (cotton stainer))、褐臭蝽 (*Euschistus servus* Say) (褐臭蝽 (brown stink bug))、*Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (单斑蝽 (one-spotted stink bug))、*Graptosthetus* 属物种 (长蝽复合体 (complex of seed bugs))、茶翅蝽 (*Halymorpha halys* Stål) (棕色大理石纹椿 (brown marmorated stink bug))、松叶根蝽

(*Leptoglossus corculus* Say) (松叶根蝽 (leaf-footed pine seed bug))、美国牧草盲蝽 (*Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois) (美国牧草盲蝽 (tarnished plant bug))、稻绿蝽 (*Nezara viridula* Linnaeus) (南方绿椿象 (Southern green stink bug))、美洲稻蝽 (*Oebalus pugnax* Fabricius) (稻蝽象 (rice stink bug))、马利筋长蝽 (*Oncopeltus fasciatus* Dallas) (大馬利筋长蝽 (large milkweed bug))、棉盲蝽 (*Pseudatomoscelis seriatus* Reuter) (棉盲蝽 (cotton fleahopper))。由本发明的化合物防治的其他昆虫目包括缨翅目 (Thysanoptera) (例如,西花蓟马 (*Frankliniella occidentalis* Pergande) (西花蓟马 (western flower thrips))、桔实蓟马 (*Scirtothrips citri* Moulton) (柑橘蓟马 (citrus thrips))、大豆蓟马 (*Sericothrips variabilis* Beach) (大豆蓟马 (soybean thrips))、以及烟蓟马 (*Thrips tabaci* Lindeman) (洋葱蓟马 (onion thrips))；和鞘翅目 (Coleoptera) (例如,马铃薯叶甲 (*Leptinotarsa decemlineata* Say) (科罗拉多马铃薯甲虫 (Colorado potato beetle))、墨西哥豆瓢虫 (*Epilachna varivestis* Mulsant) (墨西哥豆瓢虫 (Mexican bean beetle)) 以及叩甲属 (*Agriotes*)、*Athous* 属或丘胸叩甲属 (*Limonius*) 的金针虫)。

[0371] 应注意,一些同期分类体系将同翅目归类于半翅目的亚目。

[0372] 值得注意的是本发明的化合物用于防治西花蓟马 (western flower thrips) (西花蓟马 (*Frankliniella occidentalis*)) 的用途。值得注意的是本发明的化合物用于防治马铃薯叶蝉 (potato leafhopper) (马铃薯小绿叶蝉 (*Empoasca fabae*)) 的用途。值得注意的是本发明的化合物用于防治棉花蚜虫 (cotton melon aphid) (棉蚜 (*Aphis gossypii*)) 的用途。值得注意的是本发明的化合物用于防治桃蚜 (green peach aphid) (桃蚜 (*Myzus persicae*)) 的用途。值得注意的是本发明的化合物用于防治甘薯粉虱 (sweetpotato whitefly) (烟粉虱 (*Bemisia tabaci*)) 的用途。

[0373] 本发明的化合物也可用于增加作物植物的活力。该方法包括使作物植物 (例如,叶子、花、果实或根) 或生长该作物植物的种子与式1的化合物以足以实现期望的植物活力效果的量 (即生物学有效量) 接触。典型地,式1的化合物以配制的组合物施用。虽然式1的化合物通常直接施用于作物植物或其种子,但其也可以施用到作物植物的所在地,即作物植物的环境,特别是足够接近以使式1的化合物迁移到作物植物上的环境部分。与该方法相关的所在地最通常包括生长介质 (即,向植物提供营养物的介质),通常是其中生长植物的土壤。因此,为了增加作物植物的活力对作物植物的处理包括使作物植物、生长作物植物的种子或作物植物的所在地与生物学有效量的式1的化合物接触。

[0374] 增加作物活力可导致下列观察到的效果中的一项或多项: (a) 如由优异的种子发芽、作物出苗和作物挺立展示的最佳作物培植; (b) 如由快速且健康的叶生长 (例如,通过叶面积指数测量)、植物高度、分蘖数 (例如,对于稻)、根群和作物的营养体的总体干重展示的增强的作物生长; (c) 如由开花时间、开花持续时间、花的数目、总生物质积聚 (即产量) 和/或果实或谷物的产品等级可销售性 (即产质量) 展示的改善的作物产率; (d) 增强的作物耐受或预防植物病害感染和节肢动物、线虫或软体动物害虫侵袭的能力; 和 (e) 增加的作物耐受环境胁迫,诸如暴露于极端的热量、未达到最佳标准的水分或植物性毒素化学品的能力。

[0375] 相比于未经处理的植物,本发明的化合物可通过杀灭植食性无脊椎害虫或者阻止其在植物的环境中的取食而增加经处理的植物的活力。不存在植食性无脊椎害虫的这样的

防治时,害虫通过消耗植物组织或汁液,或传播植物病原体诸如病毒来降低植物活力。甚至不存在植食性无脊椎害虫时,本发明的化合物可通过改变植物的代谢来增加植物活力。一般来说,如果植物生长在非理想的环境中,即包含一个或多个不利于植物实现其在理想环境中应表现出的完全遗传潜力的方面,那么作物植物的活力会通过用本发明的化合物处理该植物最显著地增加。

[0376] 值得注意的是用于增加作物植物的活力的方法,其中该作物植物在包括植食性无脊椎害虫的环境中生长。还值得注意的是用于增加作物植物的活力的方法,其中该作物植物在不包括植食性无脊椎害虫的环境中生长。还值得注意的是用于增加作物植物的活力的方法,其中该作物植物在包括少于支持作物植物生长的理想水分量的水分量的环境中生长。值得注意的是用于增加作物植物的活力的方法,其中该作物是稻。还值得注意的是用于增加作物植物的活力的方法,其中该作物是玉蜀黍(玉米)。还值得注意的是用于增加作物植物的活力的方法,其中该作物是大豆。

[0377] 本发明的化合物还可与一种或多种其他生物学活性化合物或药剂混合以形成多组分杀虫剂,赋予甚至更广谱的农学和非农学效用,这些生物学活性化合物或药剂包括杀昆虫剂、杀真菌剂、杀线虫剂、杀菌剂、杀螨剂、除草剂、除草剂安全剂、生长调节剂诸如昆虫蜕皮抑制剂和生根刺激剂、化学不育剂、化学信息素、拒虫剂、引诱剂、信息素、取食刺激剂、其他生物学活性化合物或昆虫病原细菌、病毒或真菌。因此本发明还涉及包含生物学有效量的式1的化合物、至少一种附加组分和至少一种附加生物学活性化合物或药剂的组合物,该至少一种附加组分选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂。对于本发明的混合物,可将其他生物学活性化合物或药剂与本发明的化合物(包括式1的化合物)配制在一起以形成预混物,或者其他生物学活性化合物或药剂可与本发明的化合物(包括式1的化合物)分开配制,并且在施用前将两种制剂组合在一起(例如在喷雾罐中),或者,依次施用。

[0378] 可以与本发明的化合物配制的这样的生物学活性化合物或药剂的实例是杀昆虫剂,例如阿巴美丁(abamectin)、高灭磷、灭螨醌、啉虫脒、氟丙菊酯、啉喃环丙虫酯(afidopyropen) ([(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS) -3- [(环丙基羰基) 氧基] -1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氢-6,12-二羟基-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-4-基] 甲基环丙烷羧酸酯)、磺胺螨酯、双甲脒、阿维菌素(avermectin)、印楝素、谷硫磷、丙硫克百威、杀虫磺、联苯菊酯、联苯肼酯、双三氟虫脒、硼酸盐、噻嗪酮、硫线磷、西维因、卡巴呋喃、杀螟丹、伐虫脒、氯虫苯甲酰胺、溴虫腈、定虫隆、毒死蜱、甲基毒死蜱、环虫酰肼、螨死净(clofentezin)、噻虫胺、氰虫酰胺(3-溴-1- (3-氯-2-吡啶基) -N- [4-氰基-2-甲基-6- [(甲基氨基) 羰基] 苯基] -1H-吡唑-5-甲酰胺)、环溴虫酰胺(3-溴-N- [2-溴-4-氯-6- [[(1-环丙基乙基) 氨基] 羰基] 苯基] -1- (3-氯-2-吡啶基) -1H-吡唑-5-甲酰胺)、乙氰菊酯、环氧虫啉((5S,8R) -1- [(6-氯-3-吡啶基) 甲基] -2,3,5,6,7,8-六氢-9-硝基-5,8-环氧基-1H-咪唑并[1,2-a]吡啶因)、丁氟螨酯、氟氯氰菊酯、β-氟氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯、γ-三氟氯氰菊酯、λ-三氟氯氰菊酯、氯氰菊酯、α-氯氰菊酯、ζ-氯氰菊酯、灭蝇胺、溴氰菊酯、丁醚脒、二嗪农、狄氏剂、二氟脒、四氟甲醚菊酯、杀虫双、乐果、呋虫胺、苯虫醚、埃玛菌素、硫丹、高氰戊菊酯、乙虫腈、依芬普司、乙螨唑、苯丁锡、杀螟硫磷、苯硫威、苯氧威、甲氰菊酯、氰戊菊酯、氟虫腈、flometoquin (2-乙基-3,7-二甲基-6- [4- (三氟甲氧基) 苯氧基] -4-喹啉基碳酸甲酯)、氟啉虫酰胺、氟虫酰胺、氟氰戊菊酯、啉虫

胺、氟虫脲、氟菌螯酯((α E)-2-[[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]甲基]- α -(甲氧基亚甲基)苯乙酸甲酯)、氟噻虫砒(flufensulfone)(5-氯-2-[(3,4,4-三氟-3-丁烯-1-基)磺酰基]噻唑)、氰基硫醚类杀虫剂(fluhexafon)、氟吡菌酰胺、flupiprole(1-[2,6-二氯-4-(三氟甲基)苯基]-5-[(2-甲基-2-丙烯-1-基)氨基]-4-[(三氟甲基)亚磺酰基]-1H-吡唑-3-甲腈)、氟吡呋喃酮(4-[[6-氯-3-吡啶基]甲基](2,2-二氟乙基)氨基)-2(5H)呋喃酮)、氟胺氰菊酯、 τ -氟胺氰菊酯、地虫硫磷、伐虫脒、噻唑磷、氯虫酰胺、heptafluthrin(2,2-二甲基-3-[(1Z)-3,3,3-三氟-1-丙烯-1-基]环丙烷羧酸[2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苯基]甲酯)、氟铃脲、噻螨酮、氟蚁脒、吡虫啉、茚虫威、杀虫皂、异柳磷、虱螨脲、马拉硫磷、氯氟醚菊酯((1R,3S)-3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基环丙烷羧酸[2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苯基]甲酯)、氰氟虫脒、蜗牛敌、甲胺磷、杀扑磷、甲硫双威、灭多虫、甲氧普林、甲氧滴滴涕、甲氧苄氟菊酯、甲氧虫酰胺、甲氧苄氟菊酯、久效磷、monofluorothrin(3-(2-氰基-1-丙烯-1-基)-2,2-二甲基环丙烷羧酸[2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苯基]甲酯)、烟碱、烯啶虫胺、硝乙脲噻唑、双苯氟脲、多氟脲、草氨酰、对硫磷、甲基对硫磷、扑灭司林、甲拌磷、伏杀硫磷、亚胺硫磷、磷胺、抗蚜威、丙溴磷、丙氟菊酯(profluthrin)、克螨特、丙苯炔菊酯(protrifenbute)、pyflubumide(1,3,5-三甲基-N-(2-甲基-1-丙酰基)-N-[3-(2-甲基丙基)-4-[2,2,2-三氟-1-甲氧基-1-(三氟甲基)乙基]苯基]-1H-吡唑-4-甲酰胺)、吡蚜酮、吡啶氟虫脒(pyrafluprole)、除虫菊酯、哒螨灵、啉虫丙醚、新啉啉(间二氮杂苯)类杀虫剂(pyrifluquinazon)、啉啉胺((α E)-2-[[[2-[(2,4-二氯苯基)氨基]-6-(三氟甲基)-4-啉啉基]氧基]甲基]- α -(甲氧基亚甲基)苯乙酸甲酯)、吡啶氟虫脒(pyriprole)、蚊蝇醚、鱼藤酮、利阿诺定、氟硅菊酯、乙基多杀菌素、多杀菌素、螺螨酯、螺甲螨酯、螺虫乙酯、硫丙磷、砒虫啉(N-[甲基氧化[1-[6-(三氟甲基)-3-吡啶基]乙基]- λ^4 -磺酰亚基]氨基)-虫酰胺、吡啶胺、伏虫脲、七氟菊酯、特丁磷、杀虫畏、似虫菊、四氟醚菊酯(2,2,3,3-四甲基环丙烷羧酸[2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苯基]甲酯)、氟氰虫酰胺、噻虫啉、噻虫嗪、硫双威、杀虫双、tioazafen(3-苯基-5-(2-噻吩基)-1,2,4-噁二唑)、啉虫酰胺、四溴菊酯、啉蚜威、敌百虫、三氟苯啉(triflumezopyrim)(2,4-二氧代-1-(5-啉啉基甲基)-3-[3-(三氟甲基)苯基]-2H-吡啶并[1,2-a]啉啉鎓内盐)、杀铃脲、苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素、昆虫病原细菌、昆虫病原病毒和昆虫病原真菌。

[0379] 值得注意的是杀昆虫剂,诸如阿巴美丁、啉虫脒、氟丙菊酯、啉喃环丙虫酯、双甲脒、阿维菌素、印楝素、丙硫克百威、杀虫磺、联苯菊酯、噻嗪酮、硫线磷、西维因、杀螟丹、氯虫苯甲酰胺、溴虫脒、毒死蜱、噻虫胺、氰虫酰胺、环溴虫酰胺、乙氰菊酯、氟氯氰菊酯、 β -氟氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯、 γ -三氟氯氰菊酯、 λ -三氟氯氰菊酯、氯氰菊酯、 α -氯氰菊酯、 ζ -氯氰菊酯、灭蝇胺、溴氰菊酯、狄氏剂、呋虫胺、苯虫醚、埃玛菌素、硫丹、高氰戊菊酯、乙虫脒、依芬普司、乙螨唑、杀螟硫磷、苯硫威、苯氧威、氰戊菊酯、氟虫脒、flometoquin、氟啉虫酰胺、氟虫酰胺、氟虫脲、氟菌螯酯、氟噻虫砒、flupiprole、氟吡呋喃酮、氟胺氰菊酯、伐虫脒、噻唑磷、heptafluthrin、氟铃脲、氟蚁脒、吡虫啉、茚虫威、虱螨脲、氯氟醚菊酯、氰氟虫脒、甲硫双威、灭多虫、甲氧普林、甲氧虫酰胺、甲氧苄氟菊酯、monofluorothrin、烯啶虫胺、硝乙脲噻唑、双苯氟脲、草氨酰、pyflubumide、吡蚜酮、除虫菊酯、哒螨灵、啉虫丙醚、啉啉胺、蚊蝇醚、利阿诺定、乙基多杀菌素、多杀菌素、螺螨酯、螺甲螨酯、螺虫乙酯、砒虫啉、虫酰胺、似虫菊、四氟醚菊酯、噻虫啉、噻虫嗪、硫双威、杀虫双、四溴菊酯、啉蚜威、三氟苯啉、杀铃

脲、苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素、苏云金芽孢杆菌的所有菌株以及核型多角体病毒的所有毒株。

[0380] 用于与本发明的化合物混合的生物制剂的一个实施方案包括昆虫病原细菌诸如苏云金芽孢杆菌,和胶囊包封的苏云金芽孢杆菌的 δ -内毒素诸如由CellCap®方法制备的MVP®和MVPII®生物杀昆虫剂(CellCap®、MVP®和MVPII®是Mycogen公司,印第安纳波利斯,印第安纳州,美国(Mycogen Corporation, Indianapolis, Indiana, USA)的商标);昆虫病原真菌诸如绿僵菌;和昆虫病原(天然存在的和遗传改性的二者)病毒,包括杆状病毒、核型多角体病毒(NPV)诸如谷实夜蛾(*Helicoverpa zea*)核型多角体病毒(HzNPV)、芹菜夜蛾(*Anagrapha falcifera*)核型多角体病毒(AfNPV);和颗粒体病毒(GV),诸如苹果蠹蛾(*Cydia pomonella*)颗粒体病毒(CpGV)。

[0381] 尤其值得注意的是其中其他无脊椎害虫防治活性成分属于与式1的化合物不同的化学类别或者具有与其不同的作用位点的组合。在某些情况下,与至少一种具有相似防治谱但是不同作用位点的其他无脊椎害虫防治活性成分的组合对于抗性管理会是特别有利的。因此,本发明的组合物还可包含生物学有效量的至少一种附加无脊椎害虫防治活性成分,该活性成分具有类似的防治谱,但是属于不同的化学类别或者具有不同的作用位点。这些附加的生物学活性化合物或药剂包括但不限于乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂,诸如氨基甲酸酯类灭多虫、草酰肼、硫双威、啶虫脒和有机磷酸酯毒死蜱;GABA-门控氯离子通道拮抗剂,诸如环戊二烯类杀虫剂狄氏剂和硫丹,以及苯基吡唑类乙虫腈和氟虫腈;钠通道调节剂,诸如拟除虫菊酯联苯菊酯、氟氯氰菊酯、 β -氟氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯、 λ -三氟氯氰菊酯、氯氰菊酯、溴氰菊酯、四氟甲醚菊酯、高氰戊菊酯、甲氧苄氟菊酯和丙氟菊酯;烟碱型乙酰胆碱受体(nAChR)激动剂,诸如新烟碱啉虫脒、噻虫胺、呋虫胺、吡虫啉、烯啶虫胺、硝乙腈噻唑、噻虫啉和噻虫嗪、以及虱虫啉;烟碱型乙酰胆碱受体(nAChR)变构活化剂,诸如多杀菌素类乙基多杀菌素和多杀菌素;氯离子通道活化剂,诸如阿维菌素阿巴美丁和埃玛菌素;保幼激素模拟物,诸如苯虫醚、甲氧普林、苯氧威和蚊蝇醚;选择性同翅目取食阻滞剂,诸如吡蚜酮和氟啶虫酰胺;螨生长抑制剂,诸如乙螨唑;线粒体ATP合酶抑制剂,如克螨特;经由质子梯度破坏的氧化磷酸化的解偶联剂,诸如溴虫腈;烟碱型乙酰胆碱受体(nAChR)通道阻滞剂,诸如沙蚕毒素类似物杀螟丹;壳多糖生物合成抑制剂,诸如苯甲酰脲氟虫脲、氟铃脲、虱螨脲、双苯氟脲、多氟脲和杀铃脲、以及噻嗪酮;双翅目蜕皮干扰剂,诸如灭蝇胺;蜕皮激素受体激动剂,诸如双酰肼类甲氧虫酰肼和虫酰肼;真蛱胺受体激动剂,诸如双甲脒;线粒体复合体III电子传递抑制剂,诸如氟蚁腂;线粒体复合体I电子传递抑制剂,诸如吡啶灵;电压依赖型钠通道阻滞剂,诸如茚虫威;乙酰CoA羧化酶抑制剂,诸如季酮酸和1,5-二氢-4-羟基-2H-吡咯-2-酮(tetramic acid)螺螨酯、螺甲螨酯和螺虫乙酯;线粒体复合体II电子传递抑制剂,诸如 β -酮腈腈吡螨酯和丁氟螨酯;利阿诺定受体调节剂,诸如氨基甲酸二酰胺类氯虫苯甲酰胺、氰虫酰胺和氰虫酰胺,二酰胺类,诸如氟虫酰胺,和利阿诺定受体配体,诸如利阿诺定;其中对生物活性负责的靶位点为未知或未表征的化合物,诸如印楝素、联苯腈酯、啉虫丙醚、新啉啉啉(间二氮杂苯)类杀虫剂和三氟苯啉啉;昆虫中肠膜微生物干扰剂,诸如苏云金芽孢杆菌和它们产生的 δ -内毒素以及球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus*)和生物制剂,包括核型多角体病毒(NPV)以及其他天然存在的或遗传改性的杀虫病毒。

[0382] 本发明的化合物可与之一起配制的生物学活性化合物或药剂的另外的实例是:杀

真菌剂,诸如阿拉酸式苯-S-甲基、4-十二烷基-2,6-二甲基吗啉(aldimorph)、唑嘧菌胺、安美速、敌菌灵、戊环唑、嘧菌酯、苯霜灵(包括精苯霜灵)、麦锈灵、苯菌灵、苯噻菌胺(benthiavalicarb)(包括苯噻菌胺(benthiavalicarb-isopropyl))、苯并烯氟菌唑(benzovindiflupyr)、3-苯并[b]噻吩-2-基-5,6-二氢-1,4,2-噻嗪4-氧化物(bethoxazin)、乐杀螨、联苯、联苯三唑醇、联苯吡菌胺、灭瘟素、啉酰菌胺、糠菌唑、乙嘧酚磺酸酯、丁赛特、萎锈灵、环丙酰菌胺、敌菌丹、克菌丹、多菌灵、地茂散、百菌清、乙菌利、氢氧化铜、氧氯化铜、硫酸铜、丁香菌酯、氰霜唑、环氟菌胺、霜脲氰、环唑醇、嘧菌环胺、抑菌灵、双氯氰菌胺、哒菌清、氯硝胺、乙霉威、恶醚唑、二氟林、甲菌定、烯酰吗啉、醚菌胺、烯唑醇(包括烯唑醇-M)、敌螨普、二噻农、二硫戊环、十二环吗啉、多果定、益康唑、乙环唑、敌瘟磷、enoxastrobin(还被称为enestroburin(烯肟菌酯))、氟环唑、噻唑菌胺、乙菌定、土菌灵、噁唑菌酮、咪唑菌酮、烯肟菌胺、氯苯嘧啶醇、腈苯唑、甲呋酰苯胺、环酰菌胺、氰菌胺、拌种咯、苯锈啉、丁苯吗啉、胺苯吡菌酮、三苯基乙酸锡、三苯基氢氧化锡、福美铁、嘧菌胺、flometoquin、氟啉胺、咯菌腈、氟菌酯、氟吗啉、氟吡菌胺、氟吡菌酰胺、氟嘧菌酯、氟唑唑、氟硅唑、磺菌胺、氟噻菌净(flutianil)、氟酰胺、粉唑醇、氟唑菌酰胺、灭菌丹、四氯苯酞(还被称为苯酞)、麦穗宁、呋霜灵、呋吡菌胺、己唑醇、恶霉灵、双胍盐、抑霉唑、酰胺唑、烷苯磺酸盐标准品、双胍辛胺三乙酸盐、iodicarb、种菌唑、异丙噻菌胺(isofetamid)、异稻瘟净、异菌脲、丙森锌、稻瘟灵、吡唑萘菌胺、异噻菌胺、春雷霉素、克收欣、代森锰锌、双炔酰菌胺、mandestrobin、代森锰、mapanipyrin、灭锈胺、消螨多、甲霜灵(包括高效甲霜灵/精甲霜灵)、叶菌唑、磺菌威、代森联、苯氧菌胺、苯菌酮、腈菌唑、萘替芬(naftitine)、甲肿铁铵(甲基肿酸铁)、氟苯嘧啶醇、辛噻酮、呋酰胺、肟醚菌胺、恶霜灵、氟噻唑吡乙酮(oxathiapiprolin)、噁唑酸、噁咪唑、氧化萎锈灵、氧四环素、戊菌唑、戊菌隆、戊苯吡菌胺、吡噻菌胺、稻痕酯(perfurazoate)、亚磷酸(包括其盐,如三乙膦酸铝)、啉氧菌酯、粉病灵、多氧霉素、噻菌灵、咪鲜胺、腐霉利、霜霉威、丙环唑、甲基代森锌、丙氧喹啉、硫菌威、丙硫菌唑、唑菌胺酯、唑胺菌酯、唑菌酯、定菌磷、吡菌苯威、pyributacarb、啉斑肟、甲氧苯啉菌(pyriofenone)、perisoxazole、嘧霉胺、啉斑肟、吡咯尼群、咯唑酮、唑唑(quinconazole)、quinmethionate、唑氧灵、五氯硝基苯、硅噻菌胺、氟唑环菌胺、硅氟唑、螺环菌胺、链霉素、硫磺、戊唑醇、特弗唑啉(tebufloquin)、teclofthalam、克枯烂、四氧硝基苯、特比萘芬、氟醚唑、噻苯哒唑、噻呋酰胺、托布津、甲基硫菌灵、福美双、噻酰菌胺、甲基立枯磷、tolprocarb、甲苯氟磺胺、三唑酮、三唑醇、嘧菌醇、唑菌嗪、三元硫酸铜、氯啉菌酯、十三吗啉、肟菌酯、氟菌唑、trimoprhamide三环唑、肟菌酯、噻氮灵、灭菌唑、烯效唑、井冈霉素、霜霉灭(valifenalate)(还被称为valifenal)、乙烯菌核利、代森锌、福美锌、苯酰菌胺和1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-3-异噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮;杀线虫剂诸如氟吡菌酰胺、螺虫乙酯、硫双威、噻唑膦、阿巴美丁、异菌脲、氟噻虫砒(fluensulfone)、二甲基二硫醚、tioazafen、1,3-二氯丙烯(1,3-D)、威百亩(钠和钾)、棉隆、三氯硝基甲烷、苯线磷、丙线磷、硫线磷(cadusaphos)、特丁磷、新烟磷(imicyafos)、草氨酰、卡巴呋喃、tioazafen、坚强芽孢杆菌(Bacillusfirmus)和巴斯德杆菌(Pasteuria nishizawae);杀细菌剂诸如链霉素;杀螨剂,诸如双甲脒、灭螨猛、克氯苯、三环锡、三氯杀螨醇、除螨灵、乙螨唑、喹螨醚、苯丁锡、甲氰菊酯、唑螨酯、噻螨酮、克螨特、哒螨灵和吡螨胺。

[0383] 在某些情况下,本发明化合物与其他生物学活性(特别是无脊椎害虫防治)化合物或药剂(即活性成分)的组合可导致高于加合(即协同)的效应。降低释放在环境中的活性成分的量,同时确保有效的害虫防治一直是人们所期望的。当在施用量下发生无脊椎害虫防治活性成分的协同作用,从而赋予农学上令人满意的无脊椎害虫防治水平时,这样的组合可有利地用于降低作物生产成本并且减少环境负荷。

[0384] 可以将本发明的化合物及其组合物施用至植物,这些植物经基因转化以表达对无脊椎害虫有毒的蛋白质(诸如苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素)。这样的施用可提供更广谱的植物保护,并且对于抗性管理是有利的。本发明的化合物的外源性施用的无脊椎害虫防治的作用可与表达的毒素蛋白质协同作用。

[0385] 这些农用保护剂(即杀昆虫剂、杀真菌剂、杀线虫剂、杀螨剂、除草剂和生物制剂)的一般参考文献包括The Pesticide Manual[农药手册],第13版,C.D.S.Tomlin编辑,British Crop Protection Council [英国作物保护委员会],Famham,Surrey,U.K.,2003和The BioPesticide Manual[生物农药手册],第2版,L.G.Copping编辑,British Crop Protection Council,Farnham,Surrey,U.K.,2001。

[0386] 在农学和非农学应用中,通过将生物学有效量的一种或多种通常呈组合物形式的本发明的化合物施用到害虫环境中,包括侵袭的农学和/或非农学所在地,施用到待保护的区域中,或直接施用到待防治的害虫上,来防治无脊椎害虫。

[0387] 因此,本发明包括用于在农学和/或非农学应用中防治无脊椎害虫的方法,包括使无脊椎害虫或其环境与生物学有效量的一种或多种本发明的化合物或与包含至少一种这样的化合物的组合物或包含至少一种这样的化合物和生物学有效量的至少一种附加的生物学活性化合物或药剂的组合物接触。包含本发明的化合物和生物学有效量的至少一种附加的生物学活性化合物或药剂的合适组合物的实例包括颗粒状组合物,其中该附加的活性化合物存在于与本发明的化合物相同的颗粒上或存在于与本发明的化合物的那些颗粒分开的颗粒上。

[0388] 为实现与本发明的化合物或组合物接触以保护大田作物免受无脊椎害虫的侵害,通常在种植之前将该化合物或组合物施用到作物种子上,施用到作物植物的叶子(例如,叶、茎、花、果实)上,或在种植作物之前或之后施用到土壤或其他生长介质上。

[0389] 接触方法的一个实施方案是通过喷雾。或者,包含本发明的化合物的颗粒状组合物可以施用到植物叶子上或土壤中。本发明的化合物也可以通过使植物与作为液体制剂的土壤浸液、到土壤中的颗粒状制剂、育苗箱处理物或移植浸泡物施用的包含本发明化合物的组合物相接触通过植物吸收有效地递送。值得注意的是呈土壤浸液液体制剂形式的本发明的组合物。还值得注意的是是一种用于防治无脊椎害虫的方法,其包括使无脊椎害虫或其环境与生物学有效量的本发明的化合物或与包含生物学有效量的本发明的化合物的组合物接触。还值得注意的是这种方法,其中环境是土壤并且该组合物作为土壤浸液制剂施用到土壤中。还值得注意的是还通过局部施用到受侵袭的所在地来使本发明的化合物是有效的。其他接触方法包括通过直接喷雾和滞留喷雾、空中喷雾、凝胶、种子包衣、微胶囊化、内吸吸收、诱饵、耳标、大丸药、喷雾器、熏剂、气雾剂、粉剂以及许多其他方法来施用本发明的化合物或组合物。接触方法的一个实施方案是包含本发明的化合物或组合物的尺寸上稳定的肥料颗粒、小棒或片剂。本发明的化合物还可浸渍到用于制造无脊椎害虫防治装置(例

如,防昆虫网)的材料中。

[0390] 本发明的化合物可用于处理所有植物、植物部分和种子。植物和种子品种和栽培品种可通过常规的繁殖和育种方法或通过基因工程方法获得。经基因改性的植物或种子(转基因植物或种子)为其中异源性基因(转基因)已被稳定整合进植物或种子基因组中的那些。由其在植物基因组中的特定位置所限定的转基因被称为转化或转基因事件。

[0391] 可根据本发明处理的经基因改性的植物和种子栽培品种包括抵抗一种或多种生物胁迫(害虫,诸如线虫、昆虫、螨虫、真菌等)或非生物胁迫(干旱、低温、土壤盐化等)的那些,或包含其他期望的特征的那些。植物和种子可经基因改性以表现出性状,例如除草剂耐受性、昆虫抗性、改性的油特征或耐旱性。

[0392] 用本发明的化合物处理经基因改性的植物和种子可导致超加性或协同效应。例如,降低施用量、拓展活性谱、增加对生物胁迫/非生物胁迫的耐受性或增强贮存稳定性可大于来自仅简单在经基因改性的植物和种子上施用本发明的化合物的加性效应所期望的。

[0393] 本发明的化合物还可用于种子处理剂中以保护种子免受无脊椎害虫。在本公开和权利要求书的上下文中,处理种子意指使种子与典型地被配制成本发明的组合物的生物学有效量的本发明的化合物接触。该种子处理剂保护种子免受无脊椎土壤害虫并且总体上还可以保护由发芽种子发育成的幼苗的根和其他与土壤接触的植株部位。该种子处理剂还可以通过使本发明的化合物或第二活性成分在发育的植物中易位来向叶子提供保护。可将种子处理剂施用到所有类型的种子上,包括会发芽形成转基因植物以表达特定性状的那些。代表性实例包括表达对无脊椎害虫有毒的蛋白质的那些,诸如苏云金芽孢杆菌毒素,或表达抗除草剂性的那些,诸如提供草甘膦抗性的草甘膦乙酰转移酶。具有本发明的化合物的种子处理剂还可增加由种子生长的植物的活力。

[0394] 种子处理的一种方法是在播撒种子之前,通过用本发明的化合物(即作为配制的组合物)对种子喷雾或撒粉。经配制用于种子处理的组合物一般包含成膜剂或粘合剂。因此,典型地,本发明的种子包衣组合物包含生物学有效量的式1的化合物、其N-氧化物或盐、以及成膜剂或粘合剂。可通过将可流动的悬浮液浓缩物直接喷雾到种子的翻滚床中并且然后干燥种子来为种子包衣。或者,可将其他制剂类型诸如湿粉、溶液、悬浮乳液、乳油和水中的乳液喷雾在种子上。该方法尤其可用于将膜包衣施用在种子上。本领域技术人员可采用各种包衣设备和方法。合适的方法包括在P.Kosters等人,Seed Treatment:Progress and Prospects[种子处理:进展与前景],1994BCPC专著号57以及其中列出的参考文献中列出的那些。

[0395] 式1的化合物和它们的组合物,单独地或者与其他杀昆虫剂、杀线虫剂和杀真菌剂组合,尤其可用于对作物的种子处理,这些作物包括但不限于玉蜀黍或玉米、大豆、棉、谷类(例如,小麦、燕麦、大麦、黑麦和稻)、马铃薯、蔬菜和油菜。

[0396] 式1的化合物可与之一起配制以提供可用于种子处理的混合物的其他杀昆虫剂包括阿巴美丁、啉虫脒、氟丙菊酯、双甲脒、阿维菌素、印楝素、杀虫磺、联苯菊酯、噻嗪酮、硫线磷、西维因、卡巴呋喃、杀螟丹、氯虫苯甲酰胺、溴虫腈、毒死蜱、噻虫胺、氟虫酰胺、氟氯氰菊酯、 β -氟氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯、 γ -三氟氯氰菊酯、 λ -三氟氯氰菊酯、氯氰菊酯、 α -氯氰菊酯、 ζ -氯氰菊酯、灭蝇胺、溴氰菊酯、狄氏剂、呋虫胺、苯虫醚、埃玛菌素、硫丹、高氰戊菊酯、乙虫腈、依芬普司、乙螨唑、苯硫威、苯氧威、氰戊菊酯、氟虫腈、氟啉虫酰胺、氟虫酰胺、氟虫

脲、氟胺氰菊酯、伐虫脘、噻唑磷、氟铃脲、氟蚁脲、吡虫啉、茚虫威、虱螨脲、氰氟虫脲、甲硫威、灭多虫、甲氧普烯、甲氧虫酰胺、烯啶虫胺、硝乙脲噻唑、双苯氟脲、草氨酯、吡蚜酮、除虫菊酯、哒螨灵、啶虫丙醚、蚊蝇醚、利阿诺定、乙基多杀菌素、多杀菌素、螺螨酯、螺甲螨酯、螺虫乙酯、虱虫啉、虫酰胺、似虫菊、噻虫啉、噻虫嗪、硫双威、杀虫双、四溴菊酯、吡蚜威、杀铃脲、苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素、苏云金芽孢杆菌的所有菌株以及核型多角体病毒的所有毒株。

[0397] 式1的化合物可与之一起配制以提供可用于种子处理的混合物的杀真菌剂包括吡啶菌胺、嘧菌酯、啶酰菌胺、多菌灵、萎锈灵、霜脲氰、环唑醇、恶醚唑、烯酰吗啉、氟啶胺、咯菌腈、氟唑啉、氟吡菌胺、氟嘧菌酯、粉唑醇、氟唑菌酰胺、种菌唑、异菌脲、甲霜灵、精甲霜灵、叶菌唑、腈菌唑、多效唑、戊苯吡菌胺、啶氧菌酯、丙硫菌唑、唑菌胺酯、氟唑环菌胺、硅噻菌胺、戊唑醇、噻菌灵、甲基硫菌灵、福美双、肟菌酯和灭菌唑。

[0398] 包含对于种子处理有用的式1的化合物的组合物还可以包含细菌和真菌，该细菌和真菌具有提供保护免受植物病原真菌或细菌和/或土生动物诸如线虫的有害影响的能力。表现出杀线虫特性的细菌可包括但不限于坚强芽孢杆菌 (*Bacillus firmus*)、蜡样芽孢杆菌 (*Bacillus cereus*)、枯草芽孢杆菌 (*Bacillus subtilis*) 和穿刺巴斯德芽孢菌 (*Pasteuria penetrans*)。合适的坚强芽孢杆菌菌株是作为BioNem™可商购的菌株CNCM I-1582 (GB-126)。合适的蜡样芽孢杆菌菌株是菌株NCMM I-1592。两种芽孢杆菌菌株都公开于US 6,406,690中。表现出杀线虫活性的其他合适细菌是解淀粉芽孢杆菌 (*B. amyloliquefaciens*) IN937a和枯草芽孢杆菌 (*B. subtilis*) 菌株GB03。表现出杀真菌特性的细菌可包括但不限于短小芽孢杆菌 (*B. pumilus*) 菌株GB34。表现出杀线虫特性的真菌种类可包括但不限于疣孢漆斑菌 (*Myrothecium verrucaria*)、淡紫拟青霉 (*Paecilomyces lilacinus*) 和淡紫紫孢菌 (*Purpureocillium lilacinum*)。

[0399] 种子处理剂还可包含一种或多种天然来源的杀线虫剂，诸如被称为超敏蛋白 (harpin) 的激发子蛋白质，其是从某些细菌植物病原体诸如梨火疫病菌 (*Erwinia amylovora*) 分离的。实例是作为N-Hibit™ Gold CST可获得的Harpin-N-Tek种子处理技术。

[0400] 种子处理剂还可包含一种或多种豆科植物根结瘤细菌物种，诸如微共生固氮细菌慢生型大豆根瘤菌 (*Bradyrhizobium japonicum*)。这些接种剂可任选地包含一种或多种脂类壳寡糖 (LCO)，其是由根瘤菌细菌在豆科植物的根上引发结瘤形成期间所产生的结瘤 (Nod) 因子。例如，Optimize® brand种子处理技术结合了与接种剂组合的LCO启动子Technology™。

[0401] 种子处理剂还可包含一种或多种异黄酮，其可增加菌根真菌的根定植的水平。菌根真菌通过增强根对营养素诸如水、硫酸盐、硝酸盐、磷酸盐和金属的吸收来改进植物生长。异黄酮的实例包括但不限于金雀异黄酮、鹰嘴豆芽素A、刺芒柄花素、黄豆苷元、黄豆黄素、橙皮素、柚皮素和红车轴草素。刺芒柄花素作为菌根接种剂产品诸如PHCColonize® AG中的活性成分是可获得的。

[0402] 种子处理剂还可包含一种或多种植物活化剂，这些植物活化剂在被病原体接触后在植物中引起系统获得性抗性。引起这样的保护性机制的植物活化剂的实例是阿拉酸式苯-S-甲基。

[0403] 经处理的种子通常包含本发明的化合物，其量为约0.1g至1kg/100kg种子 (即按处

理前该种子的重量计约0.0001%至1%)。经配制用于种子处理的可流动的悬浮液典型地包含约0.5%至约70%的活性成分、约0.5%至约30%的成膜粘合剂、约0.5%至约20%的分散剂、0%至约5%的增稠剂、0%至约5%的颜料和/或染料、0%至约2%的消泡剂、0至约1%的防腐剂、以及0%至约75%的挥发性液体稀释剂。

[0404] 本发明的化合物可被结合到诱饵组合物中,该诱饵组合物被无脊椎害虫食用或用于装置诸如诱捕器、诱饵站等中。这样的诱饵组合物可呈颗粒的形式,其包含(a)活性成分,即生物学有效量的式1的化合物、其N-氧化物或盐;(b)一种或多种食物原料;任选存在地(c)引诱剂,和任选存在地(d)一种或多种湿润剂。值得注意的是颗粒或诱饵组合物,其包含约0.001%-5%的活性成分、约40%-99%的食物原料和/或引诱剂;以及任选存在地约0.05%-10%的湿润剂,其可在非常低的施用量下,尤其是通过摄取而不是通过直接接触时致命的活性成分剂量下,有效防治土壤无脊椎害虫。一些食物原料可用作食物源和引诱剂二者。食物原料包括碳水化合物、蛋白质和脂质。食物原料的实例是蔬菜粉、糖、淀粉、动物脂肪、植物油、酵母提取物和乳固体。引诱剂的实例是添味剂和调味剂,诸如水果或植物提取物、香料、或其他动物或植物组分、信息素或已知用于吸引目标无脊椎害虫的其他剂。湿润剂(即保水剂)的实例是乙二醇和其他多元醇、甘油和山梨醇。值得注意的是用于防治至少一种选自蚂蚁、白蚁和蟑螂的无脊椎害虫的诱饵组合物(以及使用这样的诱饵组合物的方法)。一种用于防治无脊椎害虫的装置,该装置可包括本发明的诱饵组合物和适配为接收该诱饵组合物的壳体,其中该壳体具有至少一个开口,该开口被定尺寸以允许该无脊椎害虫通过该开口,使得该无脊椎害虫可以从该壳体外部的的位置接近该诱饵组合物,并且其中该壳体还被适配为放置在该无脊椎害虫的潜在或已知活动的所在地中或附近。

[0405] 本发明的一个实施方案涉及一种用于防治无脊椎害虫的方法,其包括用水稀释本发明的杀虫组合物(用表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂配制的式1的化合物,或式1的化合物和至少一种其他杀虫剂的配制的混合物),以及任选地添加辅剂以形成稀释的组合物,并且使无脊椎害虫或它的环境与有效量的所述稀释的组合物接触。

[0406] 尽管通过用水稀释足够浓度的本发明的杀虫组合物形成的喷雾组合物可提供充分的防治无脊椎害虫的功效,但单独配制的辅剂产品也可被添加到喷雾罐混合物中。这些附加的辅剂通常被称为“喷雾辅剂”或“罐-混合辅剂”,并且包含混合在喷雾罐中以改善杀虫剂的性能或改变喷雾混合物的物理特性的任何物质。辅剂可为表面活性剂、乳化剂、基于石油的作物油、作物衍生的种子油、酸化剂、缓冲液、增稠剂或消泡剂。辅剂被用于增强功效(例如生物利用度、粘附性、渗透性、覆盖均匀度和保护耐久性),或最小化或消除与不相容性、起泡、飘移、蒸发、挥发和降解相关联的喷雾应用问题。为了获得最佳性能,关于活性成分的特性、制剂和目标(例如,作物、昆虫害虫)来选择辅剂。

[0407] 在喷雾辅剂之中,最通常使用油(包括作物油、作物油浓缩物、植物油浓缩物和甲基化的种子油浓缩物)来提高杀虫剂的功效,这可能是通过促进更均匀且一致的喷雾沉积来实现的。在其中可能由油或其他与水不混溶的液体引起的植物毒性是重要的情况下,由本发明的组合物制备的喷雾组合物一般会不包含油基喷雾辅剂。然而,在其中由油基喷雾辅剂造成的植物毒性在商业上无关紧要的情况下,由本发明组合物的组合物制备的喷雾组合物也可包含油基喷雾辅剂,这可潜在地进一步增加对无脊椎害虫的防治、以及耐雨性。

[0408] 确定为“作物油”的产品通常含有95%至98%的石蜡或石脑油基石油和1%至2%

的一种或多种用作乳化剂的表面活性剂。确定为“作物油浓缩物”的产品通常由80%至85%的可乳化石油基油和15%至20%的非离子表面活性剂组成。正确地确定为“植物油浓缩物”的产品通常由80%至85%的植物油(即种子油或果实油,最通常来自棉花、亚麻籽、大豆或向日葵)和15%至20%的非离子表面活性剂组成。可通过用通常衍生自植物油的脂肪酸的甲酯替代植物油改善辅剂性能。甲基化的种子油浓缩物的实例包括MSO®浓缩物(UAP-Loveland产品公司(UAP-Loveland Products, Inc.))和Premium MSO甲基化喷雾油(海伦娜化学公司(Helena Chemical Company))。

[0409] 添加到喷雾混合物中的辅剂的量通常不超过按体积计约2.5%,并且更通常地该量为按体积计约0.1%至约1%。添加到喷雾混合物中的辅剂的施用量通常为每公顷约1升至5升。喷雾辅剂的代表性实例包括:Adigor®(先正达公司(Syngenta))液烃中的47%甲基化菜籽油;Silwet®(海伦娜化学公司)聚氧化烯烃改性的七甲基三硅氧烷以及Assist®(巴斯夫公司(BASF))83%石蜡基矿物油中的17%表面活性剂共混物。

[0410] 可在无其他辅剂的情况下施用本发明的化合物,但是最常见的施用会是施用制剂,该制剂包含一种或多种具有合适的载体、稀释剂和表面活性剂的活性成分,并且根据所涵盖的最终用途有可能与食物组合。一种施用方法涉及将本发明的化合物的水分散体或精炼油溶液喷雾。与喷雾油、喷雾油浓缩液、粘展剂、辅剂、其他溶剂以及增效剂诸如胡椒基丁醚的组合通常增强化合物功效。对于非农学用途,这样的喷雾可从喷雾容器诸如罐、瓶或其他容器中,借助于泵或通过将其从加压容器例如加压气雾剂喷雾罐中释放出来施用。这样的喷雾组合物可采取多种形式,例如喷雾、薄雾、泡沫、烟雾或尘雾。因此,根据具体情况,这样的喷雾组合物还可包含抛射剂、起泡剂等。值得注意的是包含生物学有效量的本发明的化合物或组合物以及载体的喷雾组合物。这样的喷雾组合物的一个实施方案包含生物学有效量的本发明的化合物或组合物以及抛射剂。代表性的抛射剂包括但不限于甲烷、乙烷、丙烷、丁烷、异丁烷、丁烯、戊烷、异戊烷、新戊烷、戊烯、氢氟烃、氯氟烃、二甲醚和前述的混合物。值得注意的是用于防治至少一种无脊椎害虫的喷雾组合物(和使用由喷雾容器分配的这样的喷雾组合物的方法),这些无脊椎害虫选自:蚊子、墨蚊、厩蝇、鹿虻、马蝇、黄蜂、小黄蜂、大黄蜂、蜚、蜘蛛、蚂蚁、蚋等,包括单独地或以组合。

[0411] 以下测试证明本发明的化合物对特定害虫的防治功效。“防治功效”表示导致取食显著降低的无脊椎害虫发育的抑制(包括死亡率)。然而,由化合物提供的害虫防治保护不限于这些物种。化合物描述参见索引表A-G。

[0412] 本发明的生物学实施例

[0413] 用于测试A-G的制剂和喷雾方法学

[0414] 使用包含10%丙酮、90%水和300ppm Activator 90®非离子表面活性剂(Loveland Products, Loveland, Colorado, USA)的溶液来配制测试化合物。配制的化合物通过定位在每个测试单元的顶部上方1.27cm(0.5英寸)的喷雾器喷嘴以1mL的液体施用。测试化合物以指定的量被喷雾,并且每次测试重复三次。

[0415] 测试A

[0416] 为了评估对小菜蛾(diamondback moth)(小菜蛾(*Plutella xylostella* (L.)))的防治,测试单元由内部具有12-14天龄芥菜植物的小开口容器组成。用~50个新生幼虫将该植物预侵袭(pre-infest),新生幼虫使用接种器通过玉米芯糝分配至测试单元中。分散至

测试单元后,幼虫移动至测试植物上。

[0417] 配制测试化合物并且以250ppm和/或50ppm喷雾。在将配制的测试化合物喷雾后,使每个测试单元干燥1小时,然后将黑色遮蔽盖放置在顶部上。使测试单元在25℃和70%相对湿度的生长室中保持6天。然后基于食用的叶子视觉上评价植物取食损害,并评价幼虫死亡率。

[0418] 在250ppm下所测试的式1的化合物中,下列提供非常好到优异水平的防治功效(40%或更低的取食损害和/或100%的死亡率):1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、33、34、35、38、39、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、75、76、77、78、79、81、83、85、87、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、100、101、102、104、105、106、107、108、109、110、111、112、113、114、115、117、118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、129、130、131、133、139、141、142、150、151、152、153、154和155。

[0419] 在50ppm下所测试的式1的化合物中,下列提供非常好到优异水平的防治功效(40%或更低的取食损害和/或100%的死亡率):1、2、3、4、5、6、7、9、10、11、12、15、16、18、19、20、21、22、23、25、26、27、28、29、33、34、35、42、43、44、45、46、47、48、49、50、52、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、75、76、77、79、81、83、87、89、90、91、92、93、94、96、100、101、102、104、105、106、108、111、113、114、117、118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、129、130、131、139、150和151。

[0420] 测试B

[0421] 为了评估对秋夜蛾(fall armyworm)(草地贪夜蛾(*Spodoptera frugiperda* (J.E.Smith)))的防治,测试单元由内部具有4-5天龄玉米(corn或maize)植物的小开口容器组成。用一片昆虫食物(insect diet)上的10-15个1天龄幼虫将该植物预侵袭。

[0422] 配制测试化合物并且以250ppm和/或50ppm喷雾。在将配制的测试化合物喷雾后,使测试单元在25℃和70%相对湿度的生长室中保持6天。然后基于食用的叶子视觉上评价植物取食损害,并评价幼虫死亡率。

[0423] 在250ppm下所测试的式1的化合物中,下列提供非常好到优异水平的防治功效(40%或更低的取食损害和/或100%的死亡率):2、3、5、6、7、8、11、15、18、19、21、23、24、25、26、27、28、29、33、34、35、42、43、46、47、48、50、53、55、56、57、58、61、62、63、65、66、67、68、71、72、77、81、87、90、91、92、93、94、95、96、100、104、106、114、118、119、120、121、122、123、124、126、127、128、130、131、151和154。

[0424] 在50ppm下所测试的式1的化合物中,下列提供非常好到优异水平的防治功效(40%或更低的取食损害和/或100%的死亡率):5、7、8、21、25、48、57、62、63、65、72、92、93、94、96、120、121、122、123、124、130、151和154。

[0425] 测试C

[0426] 为了通过接触和/或内吸手段评估对玉米飞虱(corn planthopper)(玉米蜡蝉(*Peregrinus maidis* (Ashmead)))的防治,测试单元由内部具有3-4天龄玉米植物的小开口容器组成。将白沙加至土壤顶部,然后施用测试化合物。

[0427] 配制测试化合物并且以250ppm和/或50ppm喷雾。在将配制的测试化合物喷雾后,使测试单元干燥1小时,然后用~15-20个若虫(18至21天龄)将测试单元后侵袭(post-

infest)。将黑色遮蔽盖放置在测试单元的顶部上,并使测试单元在22-24℃和50-70%相对湿度的生长室中保持6天。然后视觉上评价每个测试单元的昆虫死亡率。

[0428] 在250ppm下所测试的式1的化合物中,下列导致至少80%的死亡率:1、3、4、6、7、10、15、16、18、21、22、25、27、28、29、30、32、33、43、44、45、46、47、48、50、56、57、58、61、66、67、72、75、81、90、98、104、110、111、113、114、117、118、120、122、125、127、133、135、139和149。

[0429] 在50ppm下所测试的式1的化合物中,下列导致至少80%的死亡率:1、3、6、10、16、27、28、29、30、32、43、44、45、46、47、48、50、58、61、66、72、76、81、90、94、98、104、110、111、113、120、122和149。

[0430] 测试D

[0431] 为了通过接触和/或内吸手段评估对马铃薯叶蝉 (potato leafhopper) (马铃薯小绿叶蝉 (*Empoasca fabae* (Harris))) 的防治,测试单元由内部具有5-6天龄Soleil豆植物 (初生叶出现) 的小开口容器组成。将白沙加至土壤顶部,在施用测试化合物前切下初生叶中的一个。

[0432] 配制测试化合物并且以250ppm和/或50ppm喷雾。在将配制的测试化合物喷雾后,使测试单元干燥1小时,然后用5个马铃薯叶蝉 (18至21天龄成虫) 将测试单元后侵袭。将黑色遮蔽盖放置在测试单元的顶部上,并使测试单元在20℃和70%相对湿度的生长室中保持6天。然后视觉上评价每个测试单元的昆虫死亡率。

[0433] 在250ppm下所测试的式1的化合物中,下列导致至少80%的死亡率:1、2、3、4、5、6、7、11、16、18、21、22、23、25、27、28、29、30、32、33、34、35、43、44、45、46、47、48、50、51、56、57、58、61、62、63、64、66、68、69、71、72、75、76、77、79、81、84、87、88、89、90、91、92、93、94、96、97、98、100、101、104、105、106、108、109、110、113、114、117、118、119、120、122、124、125、127、131、135、139、145、146和149。

[0434] 在50ppm下所测试的式1的化合物中,下列导致至少80%的死亡率:1、2、3、5、6、11、25、27、28、29、30、32、34、43、44、45、46、47、48、50、57、61、62、63、66、67、68、69、71、72、75、76、77、79、81、87、88、90、91、92、93、94、96、97、98、101、106、109、114、117、118、119、120、122、124、125、126、127和139。

[0435] 测试E

[0436] 为了通过接触和/或内吸手段评估对桃蚜 (green peach aphid) (桃蚜 (*Myzus persicae* (Sulzer))) 的防治,测试单元由内部具有12-15天龄萝卜植物的小开口容器组成。通过在测试植物的叶上放置30-40条位于一片从栽培植物上切下的 (切叶方法) 叶上的蚜虫将该植物预侵袭。随着叶片脱水,蚜虫移动至测试植物上。预侵袭后,用一层沙覆盖测试单元的土壤。

[0437] 配制测试化合物并且以250ppm和/或50ppm喷雾。在将配制的测试化合物喷雾后,使每个测试单元干燥1小时并且然后将黑色遮蔽盖放置在顶部上。使测试单元在19℃-21℃和50%-70%相对湿度的生长室中保持6天。然后视觉上评价每个测试单元的昆虫死亡率。

[0438] 在250ppm下所测试的式1的化合物中,下列导致至少80%的死亡率:1、3、11、16、46、76、98、109、110、111、113、114、127和149。

[0439] 在50ppm下所测试的式1的化合物中,下列导致至少80%的死亡率:3和76。

[0440] 测试F

[0441] 为了通过接触和/或内吸手段评估对棉花蚜虫(cotton melon aphid)(棉蚜(*Aphis gossypii* (Glover)))的防治,测试单元由内部具有5天龄秋葵植物的小开口容器组成。用30-40条位于根据切叶方法的一片叶上的昆虫将该植物预侵袭,并用一层沙覆盖测试单元的土壤。

[0442] 配制测试化合物并且以250ppm和/或50ppm喷雾。喷雾后,使测试单元在19℃和70%相对湿度的生长室中保持6天。然后视觉上评价每个测试单元的昆虫死亡率。

[0443] 在250ppm下所测试的式1的化合物中,下列导致至少80%的死亡率:1、3、25、27、30、33、50、51、57、64、76、93、94、97、98、108、110、111、113、127、133和135。

[0444] 在50ppm下所测试的式1的化合物中,下列导致至少80%的死亡率:1、3和76。

[0445] 测试G

[0446] 为了通过接触和/或内吸手段评估对西花蓟马(Western Flower Thrips)(西花蓟马(*Frankliniella occidentalis* (Pergande)))的防治,测试单元由内部具有5-7天龄Soleil豆植物的小开口容器组成。

[0447] 配制测试化合物并且以250ppm和/或50ppm喷雾。喷雾后,使测试单元干燥1小时,并且然后将60条蓟马(成虫和若虫)加入到每个单元中。将黑色遮蔽盖放置在顶部上,并使测试单元在25℃和45%-55%相对湿度下保持6天。然后视觉上评价每个测试单元的植物损害和昆虫死亡率。

[0448] 在250ppm下所测试的式1的化合物中,下列提供非常好到优异水平的防治功效(30%或更低的植物损害和/或100%的死亡率):1、3、6和76。

[0449] 在50ppm下所测试的式1的化合物中,下列提供非常好到优异水平的防治功效(30%或更低的植物损害和/或100%的死亡率):1和3。