

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl.



[12] 发明专利申请公布说明书

A01N 47/28 (2006.01)
C07C 335/12 (2006.01)
A01P 7/04 (2006.01)

[21] 申请号 200680017964.0

[43] 公开日 2008年5月14日

[11] 公开号 CN 101179936A

[22] 申请日 2006.5.18

[21] 申请号 200680017964.0

[30] 优先权

[32] 2005.5.23 [33] US [31] 60/683,666

[86] 国际申请 PCT/EP2006/062413 2006.5.18

[87] 国际公布 WO2006/125745 英 2006.11.30

[85] 进入国家阶段日期 2007.11.23

[71] 申请人 巴斯福股份公司

地址 德国路德维希港

[72] 发明人 M·科德斯 M·霍夫曼 M·普尔

N·格策 M·拉克 L·泰代斯基

M·F·特雷西 D·L·卡伯特森

T·布奇 D·G·库恩

H·奥隆米-萨迪吉

F·J·布劳恩 D·D·安斯帕夫

[74] 专利代理机构 北京市中咨律师事务所

代理人 刘金辉 林柏楠

权利要求书9页 说明书45页

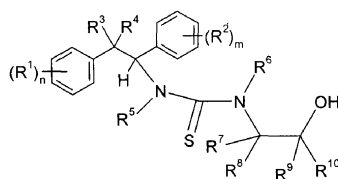
[54] 发明名称

用于对抗动物害虫的 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物

[57] 摘要

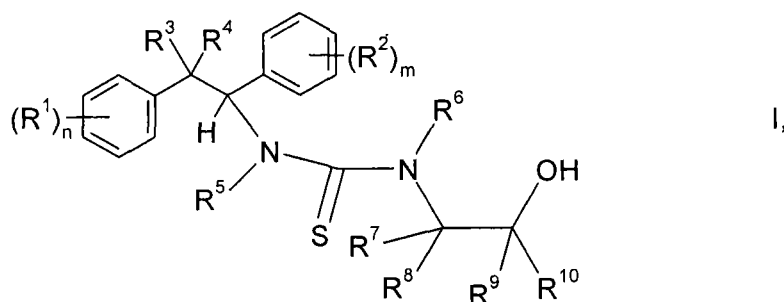
本发明涉及一种对抗动物害虫的方法，包括使动物害虫，其栖息地，繁殖地，食物供应源，动物害虫生长或可能生长于其中的植物、种子、土壤、区域、材料或环境或需要防止动物侵袭或侵染的材料、植物、种子、土壤、表面或空间与杀虫有效量的至少一种 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物 I 或其可农用盐接触，其中 m 为 0-5，n 为 0-5，R³ 和 R⁴ 为 H 或任选取代的烷基、卤代烷基、环烷基、苯基或苄基，R⁷、R⁸、R⁹ 和 R¹⁰ 为 H 或任选取代的 C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基、C₁-C₆ 烷基氨基、C₁-C₆ 烷氧基、C₃-C₆ 环烷基、苯基或苄基，以及变量 R¹、R²、R⁵ 和 R⁶ 如权利要求书中所定义。本发明还涉及一种保护作物以防动

物害虫侵袭或侵染的方法，一种保护非活体材料以防动物害虫侵袭或侵染的方法，新型 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物 I 及其可农用盐以及包含 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物 I 或其盐的农用组合物。



(I)

1. 一种对抗动物害虫的方法，包括使动物害虫，其栖息地，繁殖地，食物供应源，动物害虫生长或可能生长于其中的植物、种子、土壤、区域、材料或环境或需要防止动物侵袭或侵染的材料、植物、种子、土壤、表面或空间与杀虫有效量的至少一种式 I 的 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物和/或至少一种其可农用盐接触：



其中

m 为 0、1、2、3、4 或 5；

n 为 0、1、2、3、4 或 5；

R^1 、 R^2 各自独立地为

- 卤素、OH、SH、 NH_2 、 SO_3H 、 $COOH$ 、氰基、硝基、甲酰基，
- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷基氨基、二(C_1 - C_6 烷基)氨基、 C_1 - C_8 烷硫基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 链烯氧基、 C_2 - C_6 链烯基氨基、 C_2 - C_6 链烯硫基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_2 - C_6 炔基氨基、 C_2 - C_6 炔硫基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基、 C_1 - C_6 烷基亚磺酰基、 C_2 - C_6 链烯基磺酰基、 C_2 - C_6 炔基磺酰基、(C_1 - C_6 烷基)羰基、(C_2 - C_6 链烯基)羰基、(C_2 - C_6 炔基)羰基、(C_1 - C_6 烷氧基)羰基、(C_2 - C_6 链烯氧基)羰基、(C_2 - C_6 炔氧基)羰基、(C_1 - C_6 烷基)羰基氧基、(C_2 - C_6 链烯基)羰基氧基或(C_2 - C_6 炔基)羰基氧基，

其中上述基团的脂族基团中的碳原子可以带有 1、2 或 3 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 链烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基和 C_1 - C_6 烷硫基的基团的任何组合；

- $C(O)NR^aR^b$ 、 $(SO_2)NR^aR^b$ 、基团 Y-Ar 或基团 Y-Cy, 其中 Y 为单键、氧、硫、 C_1-C_6 链烷二基或 C_1-C_6 链烷二基氧基; Ar 为苯基、萘基或单环或双环 5-10 员杂芳族环, 该环含有 1、2、3 或 4 个选自 2 个氧、2 个硫和 3 个氮原子的杂原子作为环成员, 其中 Ar 未被取代或可以带有 1-5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_2-C_6 链烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基和 C_1-C_6 烷硫基的基团的任何组合; 和

Cy 为 C_3-C_{12} 环烷基, 其未被取代或被 1-5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_2-C_6 链烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基和 C_1-C_6 烷硫基的基团取代;

以及其中与苯基环的相邻碳原子连接的两个基团 R^1 或两个基团 R^2 可以与所述碳原子一起形成稠合苯环、稠合的饱和或部分不饱和 5、6 或 7 员碳环或稠合的 5、6 或 7 员杂环, 该杂环含有 1、2、3 或 4 个选自 2 个氧、2 个硫和 3 个氮原子的杂原子作为环成员, 并且其中该稠合环未被取代或可以带有 1、2、3 或 4 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_2-C_6 链烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基和 C_1-C_6 烷硫基的基团;

R^3 、 R^4 各自独立地为

- 氢、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基或 C_3-C_6 环烷基, 其中后 3 个基团中的碳原子可以带有 1、2 或 3 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_2-C_6 链烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基和 C_1-C_6 烷硫基的基团的任何组合, 或
- 苯基或苄基, 各自未被取代或被 1-5 个相互独立地选自 5 个卤素、3 个 C_1-C_6 烷基、3 个 C_1-C_6 卤代烷基、3 个 C_1-C_6 烷硫基、3 个 C_1-C_6 卤代烷硫基、3 个 C_1-C_6 烷氧基和 3 个 C_1-C_6 卤代烷氧基的基团取代;

R^5 为氢、氰基、硝基、甲酰基、 C_1-C_6 烷基、 $(C_1-C_6$ 烷基)羰基或 $(C_1-C_6$ 烷

氧基)羰基, 其中上述基团的脂族基团中的碳原子可以带有 1、2 或 3 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_2-C_6 链烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基和 C_1-C_6 烷硫基的基团的任何组合, 或

R^5 为 $C(O)NR^cR^d$ 或 $(SO_2)NR^cR^d$ 、苯基、苯氧基或苄基, 后提到的 3 个基团各自可以未被取代或被 1-5 个相互独立地选自 5 个卤素、3 个 C_1-C_6 烷基、3 个 C_1-C_6 卤代烷基、3 个 C_1-C_6 烷硫基、3 个 C_1-C_6 卤代烷硫基、3 个 C_1-C_6 烷氧基和 3 个 C_1-C_6 卤代烷氧基的基团取代;

R^6 为氢、氰基、硝基、 C_1-C_6 烷基、甲酰基、(C_1-C_6 烷基)羰基、(C_1-C_6 烷氧基)羰基、(C_1-C_6 烷硫基)羰基, 其中上述基团的脂族基团中的碳原子可以带有 1、2 或 3 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_2-C_6 链烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基和 C_1-C_6 烷硫基的基团的任何组合, 或

R^6 为 $C(O)NR^eR^f$ 、 $(SO_2)NR^eR^f$ 、苯基、苯氧基或苄基, 后提到的 3 个基团各自可以未被取代或被 1-5 个相互独立地选自 5 个卤素、3 个 C_1-C_6 烷基、3 个 C_1-C_6 卤代烷基、3 个 C_1-C_6 烷硫基、3 个 C_1-C_6 卤代烷硫基、3 个 C_1-C_6 烷氧基和 3 个 C_1-C_6 卤代烷氧基的基团取代;

R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 各自独立地为:

- 氢,
- C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_1-C_6 烷基氨基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_3-C_6 环烷基, 其中这些基团中的碳原子可以带有 1、2 或 3 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_2-C_6 链烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基和 C_1-C_6 烷硫基的基团的任何组合,
- 苯基或苄基, 各自未被取代或被 1-5 个相互独立地选自 5 个卤素、3 个 C_1-C_6 烷基、3 个 C_1-C_6 卤代烷基、3 个 C_1-C_6 烷硫基、3 个 C_1-C_6 卤代烷硫基、3 个 C_1-C_6 烷氧基和 3 个 C_1-C_6 卤代烷氧基的基团取代;

R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e 、 R^f 各自独立地为氢、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 链烯基或 C_2-C_6 炔基, 其中后 3 个基团中的碳原子可以带有 1、2 或 3 个相

互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 链烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基和 C_1 - C_6 烷硫基的基团。

2. 如权利要求1所要求的方法，其中 R^3 为氢或 C_1 - C_4 烷基。

3 如权利要求1所要求的方法，其中 R^4 为氢、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基或苯基，其中苯基未被取代或被1-5个相互独立地选自5个卤素、3个 C_1 - C_6 烷基、3个 C_1 - C_6 卤代烷基、3个 C_1 - C_6 烷硫基、3个 C_1 - C_6 卤代烷硫基、3个 C_1 - C_6 烷氧基和3个 C_1 - C_6 卤代烷氧基的基团取代。

4. 如权利要求1所要求的方法，其中 R^3 和 R^4 均为氢。

5. 如权利要求1所要求的方法，其中 R^3 为氢且 R^4 选自 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基或苯基，其中苯基未被取代或被1-5个相互独立地选自5个卤素、3个 C_1 - C_6 烷基、3个 C_1 - C_6 卤代烷基、3个 C_1 - C_6 烷硫基、3个 C_1 - C_6 卤代烷硫基、3个 C_1 - C_6 烷氧基和3个 C_1 - C_6 卤代烷氧基的基团取代。

6. 如权利要求1所要求的方法，其中 R^5 为氢且 R^6 为氢、氰基、甲酰基、 C_1 - C_4 烷基、(C_1 - C_4 烷基)羰基、(C_1 - C_4 卤代烷基)羰基、(C_1 - C_4 烷氧基)羰基、 C_1 - C_4 烷氧基-(C_1 - C_4 烷氧基)羰基或(C_1 - C_4 烷硫基)羰基。

7. 如权利要求1所要求的方法，其中 R^5 为氢、氰基、甲酰基、 C_1 - C_4 烷基、(C_1 - C_4 烷基)羰基、(C_1 - C_4 卤代烷基)羰基、(C_1 - C_4 烷氧基)羰基、 C_1 - C_4 烷氧基-(C_1 - C_4 烷氧基)羰基或(C_1 - C_4 烷硫基)羰基且 R^6 为氢。

8. 如权利要求1所要求的方法，其中 R^5 为氢。

9. 如权利要求1所要求的方法，其中 R^5 和 R^6 为氢。

10. 如权利要求1所要求的方法，其中基团 R^7 、 R^8 、 R^9 和 R^{10} 各自为氢。

11. 如权利要求1所要求的方法，其中基团 R^7 、 R^8 、 R^9 和 R^{10} 中的至少一个不为氢。

12. 如权利要求1所要求的方法，其中式I中的n为1、2或3。

13. 如权利要求1所要求的方法，其中式I中的m为1、2或3。

14. 如权利要求1所要求的方法, 其中 $n+m$ 为 2、3、4 或 5 的整数。

15. 如权利要求1所要求的方法, 其中 R^1 和 R^2 各自独立地选自卤素、OH、SH、 NH_2 、 SO_3H 、COOH、氰基、硝基、甲酰基、可以带有 1-3 个卤素的 C_1-C_4 烷基、可以带有 1-3 个卤素的 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_6 烷基氨基、(C_1-C_6 烷氧基)羰基和苯基, 其中苯基未被取代或被 1-5 个相互独立地选自 5 个卤素、3 个 C_1-C_6 烷基、3 个 C_1-C_6 卤代烷基、3 个 C_1-C_6 烷硫基、3 个 C_1-C_6 卤代烷硫基、3 个 C_1-C_6 烷氧基和 3 个 C_1-C_6 卤代烷氧基的基团取代。

16. 如权利要求1所要求的方法, 其中所述害虫为昆虫、蜘蛛或线虫。

17. 一种保护作物以防动物害虫侵袭或侵染的方法, 包括使作物与杀虫有效量的至少一种如权利要求1-15中任一项所定义的式I的1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物和/或至少一种其可农用盐接触。

18. 如权利要求17所要求的方法, 其中所述害虫为昆虫、蜘蛛或线虫。

19. 一种保护非活体材料以防动物害虫侵袭或侵染的方法, 该方法包括使非活体材料与杀虫有效量的至少一种如权利要求1-15中任一项所定义的式I的1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物和/或其可农用盐接触。

20. 如权利要求19所要求的方法, 其中所述害虫为昆虫、蜘蛛或线虫。

21. 如权利要求1-15中任一项所定义的式I的1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物及其可农用盐在对抗动物害虫中的用途。

22. 如权利要求1-15中任一项所定义的式I的1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物及其可农用盐在保护作物以防动物害虫侵袭或侵染中的用途。

23. 如权利要求1-15中任一项所定义的式I的1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物及其可农用盐在保护非活体材料以防动物害虫侵袭或侵染中的用途。

24. 一种保护种子以防动物害虫并保护秧苗的根和芽以防动物害虫的方法, 包括使种子在播种之前和/或在催芽之后与如权利要求1-15中任一项所定义的式I的1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物和/或至少一种其可农用盐以杀虫有效量接触。

25. 根据权利要求 24 的方法, 其中以 0.1g-10kg/100kg 种子的量施用如权利要求 1-15 中任一项所定义的式 I 的 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物。

26. 根据权利要求 24 的方法, 其中保护所得植物的根和芽。

27. 根据权利要求 24 的方法, 其中保护所得植物的芽以防蚜虫。

28. 如权利要求 1-15 中任一项所定义的式 I 的 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物在保护种子以防土壤害虫以及保护所得植物的根和芽以防土壤害虫或叶部害虫中的用途。

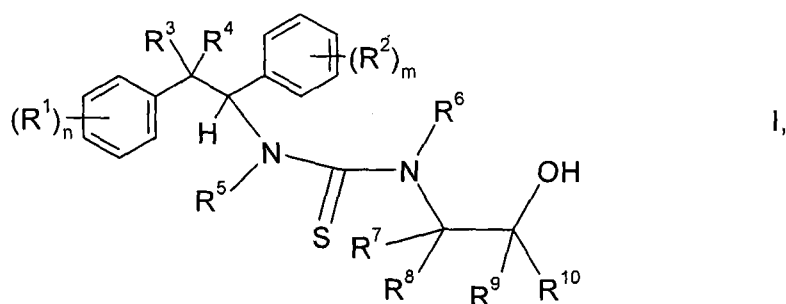
29. 根据权利要求 28 的用途, 其中以 0.1g-10kg/100kg 种子的量施用式 I 的 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物。

30. 如权利要求 1-15 中任一项所定义的式 I 的 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物在保护所得植物的芽以防蚜虫中的用途。

31. 种子, 以 0.1g-10kg/100kg 种子的量包含如权利要求 1-15 中任一项所定义的式 I 的 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物或 I 的可农用盐。

32. 一种农用组合物, 包含呈现杀虫作用的量的至少一种如权利要求 1-15 中任一项所定义的式 I 的 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物和/或至少一种其盐, 以及至少一种惰性固体和/或液体可农用载体和需要的话至少一种表面活性剂。

33. 式 I 的 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物和/或其可农用盐:



其中

m 为 0、1、2、3、4 或 5;

n 为 0、1、2、3、4 或 5;

R^1 、 R^2 各自独立地为

- 卤素、OH、SH、 NH_2 、 SO_3H 、COOH、氰基、硝基、甲酰基，
- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷基氨基、二(C_1 - C_6 烷基)氨基、 C_1 - C_8 烷硫基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 链烯氧基、 C_2 - C_6 链烯基氨基、 C_2 - C_6 链烯硫基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_2 - C_6 炔基氨基、 C_2 - C_6 炔硫基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基、 C_1 - C_6 烷基亚磺酰基、 C_2 - C_6 链烯基磺酰基、 C_2 - C_6 炔基磺酰基、(C_1 - C_6 烷基)羰基、(C_2 - C_6 链烯基)羰基、(C_2 - C_6 炔基)羰基、(C_1 - C_6 烷氧基)羰基、(C_2 - C_6 链烯氧基)羰基、(C_2 - C_6 炔氧基)羰基、(C_1 - C_6 烷基)羰基氧基、(C_2 - C_6 链烯基)羰基氧基或(C_2 - C_6 炔基)羰基氧基，

其中上述基团的脂族基团中的碳原子可以带有 1、2 或 3 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 链烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基和 C_1 - C_6 烷硫基的基团的任何组合；

- $C(O)NR^aR^b$ 、 $(SO_2)NR^aR^b$ 、基团 Y-Ar 或基团 Y-Cy，其中 Y 为单键、氧、硫、 C_1 - C_6 链烷二基或 C_1 - C_6 链烷二基氧基；Ar 为苯基、萘基或单环或双环 5-10 员杂芳族环，该环含有 1、2、3 或 4 个选自 2 个氧、2 个硫和 3 个氮原子的杂原子作为环成员，其中 Ar 未被取代或可以带有 1-5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 链烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基和 C_1 - C_6 烷硫基的基团的任何组合；和

Cy 为 C_3 - C_{12} 环烷基，其未被取代或被 1-5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 链烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基和 C_1 - C_6 烷硫基的基团取代；

以及其中与苯基环的相邻碳原子连接的两个基团 R^1 或两个基团 R^2 可以与所述碳原子一起形成稠合苯环、稠合的饱和或部分不饱和 5、6 或 7 员碳环或稠合的 5、6 或 7 员杂环，该杂环含有 1、2、3 或 4 个选自 2

个氧、2个硫和3个氮原子的杂原子作为环成员，并且其中该稠合环未被取代或可以带有1、2、3或4个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_2-C_6 链烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基和 C_1-C_6 烷硫基的基团；

R^3 、 R^4 各自独立地为

- 氢、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基或 C_3-C_6 环烷基，其中后3个基团中的碳原子可以带有1、2或3个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_2-C_6 链烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基和 C_1-C_6 烷硫基的基团的任何组合，或
- 苯基或苄基，各自未被取代或被1-5个相互独立地选自5个卤素、3个 C_1-C_6 烷基、3个 C_1-C_6 卤代烷基、3个 C_1-C_6 烷硫基、3个 C_1-C_6 卤代烷硫基、3个 C_1-C_6 烷氧基和3个 C_1-C_6 卤代烷氧基的基团取代；

R^5 为氢、氰基、硝基、甲酰基、 C_1-C_6 烷基、(C_1-C_6 烷基)羰基或(C_1-C_6 烷氧基)羰基，其中上述基团的脂族基团中的碳原子可以带有1、2或3个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_2-C_6 链烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基和 C_1-C_6 烷硫基的基团的任何组合，或

R^5 为 $C(O)NR^cR^d$ 或 $(SO_2)NR^cR^d$ 、苯基、苯氧基或苄基，后提到的3个基团各自可以未被取代或被1-5个相互独立地选自5个卤素、3个 C_1-C_6 烷基、3个 C_1-C_6 卤代烷基、3个 C_1-C_6 烷硫基、3个 C_1-C_6 卤代烷硫基、3个 C_1-C_6 烷氧基和3个 C_1-C_6 卤代烷氧基的基团取代；

R^6 为氢、氰基、硝基、 C_1-C_6 烷基、甲酰基、(C_1-C_6 烷基)羰基、(C_1-C_6 烷氧基)羰基、(C_1-C_6 烷硫基)羰基，其中上述基团的脂族基团中的碳原子可以带有1、2或3个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_2-C_6 链烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基和 C_1-C_6 烷硫基的基团的任何组合，或

R^6 为 $C(O)NR^eR^f$ 、 $(SO_2)NR^eR^f$ 、苯基、苯氧基或苄基，后提到的3个基团各自可以未被取代或被1-5个相互独立地选自5个卤素、3个 C_1-C_6 烷

基、3个 C₁-C₆ 卤代烷基、3个 C₁-C₆ 烷硫基、3个 C₁-C₆ 卤代烷硫基、3个 C₁-C₆ 烷氧基和3个 C₁-C₆ 卤代烷氧基的基团取代；

R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰ 各自独立地为：

- 氢，
- C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基、C₁-C₆ 烷基氨基、C₁-C₆ 烷氧基、C₃-C₆ 环烷基，其中这些基团中的碳原子可以带有 1、2 或 3 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₂-C₆ 链烯氧基、C₂-C₆ 炔氧基、C₁-C₆ 卤代烷氧基和 C₁-C₆ 烷硫基的基团的任何组合，
- 苯基或苄基，各自未被取代或被 1-5 个相互独立地选自 5 个卤素、3 个 C₁-C₆ 烷基、3 个 C₁-C₆ 卤代烷基、3 个 C₁-C₆ 烷硫基、3 个 C₁-C₆ 卤代烷硫基、3 个 C₁-C₆ 烷氧基和 3 个 C₁-C₆ 卤代烷氧基的基团取代；

R^a、R^b、R^c、R^d、R^e、R^f 各自独立地为氢、C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 链烯基或 C₂-C₆ 炔基，其中后 3 个基团中的碳原子可以带有 1、2 或 3 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₂-C₆ 链烯氧基、C₂-C₆ 炔氧基、C₁-C₆ 卤代烷氧基和 C₁-C₆ 烷硫基的基团；

条件是 R⁵ 和 R⁶ 不同时为氢。

用于对抗动物害虫的 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物

本发明涉及用于对抗动物害虫的 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物。

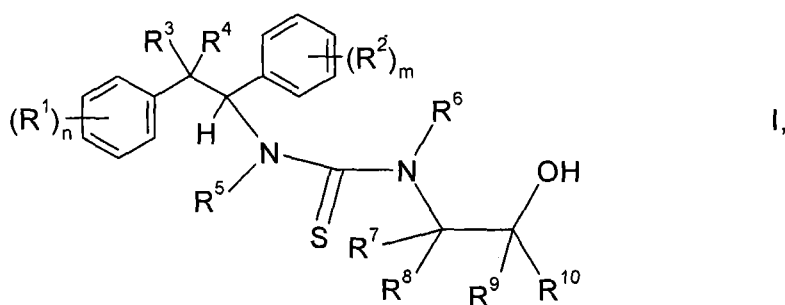
动物害虫，尤其是昆虫、蜘蛛和线虫破坏生长和收获的作物并侵袭木质住宅和商业结构体，对食品供应和财产造成大的经济损失。尽管已知许多杀虫试剂，但由于目标害虫能够对所述试剂产生抗性，因此仍然需要对抗动物害虫的新试剂。尤其难以有效控制的是诸如昆虫、蜘蛛和线虫的动物害虫。

因此，本发明的目的是提供具有良好杀虫活性并对大量不同动物害虫，尤其是难以控制的昆虫、蜘蛛和线虫具有宽活性谱的化合物。

其中 R^5 和 R^6 均为氢的式 I 化合物已经在较早的申请 PCT/EP 2004/014623 中作为中间体描述过。

然而，迄今为止没有将 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物用于对抗动物害虫的描述。

已经发现式 I 的 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物及其可农用盐呈现高杀虫活性且对宽范围的动物害虫，尤其是昆虫、蜘蛛和线虫有活性：



其中

m 为 0、1、2、3、4 或 5；

n 为 0、1、2、3、4 或 5；

X 为硫或氧；

R^1 、 R^2 各自独立地为

- 卤素、OH、SH、 NH_2 、 SO_3H 、COOH、氰基、硝基、甲酰基，
- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷基氨基、二(C_1 - C_6 烷基)氨基、 C_1 - C_8 烷硫基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 链烯氧基、 C_2 - C_6 链烯基氨基、 C_2 - C_6 链烯硫基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_2 - C_6 炔基氨基、 C_2 - C_6 炔硫基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基、 C_1 - C_6 烷基亚磺酰基(sulfoxyl)、 C_2 - C_6 链烯基磺酰基、 C_2 - C_6 炔基磺酰基、(C_1 - C_6 烷基)羰基、(C_2 - C_6 链烯基)羰基、(C_2 - C_6 炔基)羰基、(C_1 - C_6 烷氧基)羰基、(C_2 - C_6 链烯氧基)羰基、(C_2 - C_6 炔氧基)羰基、(C_1 - C_6 烷基)羰基氧基、(C_2 - C_6 链烯基)羰基氧基或(C_2 - C_6 炔基)羰基氧基，

其中上述基团的脂族基团中的碳原子可以带有 1、2 或 3 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 链烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基和 C_1 - C_6 烷硫基的基团的任何组合；

- $C(O)NR^aR^b$ 、 $(SO_2)NR^aR^b$ 、基团 Y-Ar 或基团 Y-Cy，其中 Y 为单键、氧、硫、 C_1 - C_6 链烷二基(alkandiyl)或 C_1 - C_6 链烷二基氧基(alkandiyloxy)；

Ar 为苯基、萘基或单环或双环 5-10 员杂芳族环，该环含有 1、2、3 或 4 个选自 2 个氧、2 个硫和 3 个氮原子的杂原子作为环成员，其中 Ar 未被取代或可以带有 1-5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 链烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基和 C_1 - C_6 烷硫基的基团的任何组合；和

Cy 为 C_3 - C_{12} 环烷基，其未被取代或被 1-5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 链烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基和 C_1 - C_6 烷硫基的基团取代；

以及其中与苯基环的相邻碳原子连接的两个基团 R^1 或两个基团 R^2 可以与所述碳原子一起形成稠合苯环、稠合的饱和或部分不饱和 5、6 或 7

员碳环或稠合的 5、6 或 7 员杂环，该杂环含有 1、2、3 或 4 个选自 2 个氧、2 个硫和 3 个氮原子的杂原子作为环成员，并且其中该稠合环未被取代或可以带有 1、2、3 或 4 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_2-C_6 链烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基和 C_1-C_6 烷硫基的基团；

R^3 、 R^4 各自独立地为氢、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基或 C_3-C_6 环烷基，其中后 3 个基团中的碳原子可以带有 1、2 或 3 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_2-C_6 链烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基和 C_1-C_6 烷硫基的基团的任何组合，或

苯基或苄基，各自未被取代或被 1-5 个相互独立地选自 5 个卤素、3 个 C_1-C_6 烷基、3 个 C_1-C_6 卤代烷基、3 个 C_1-C_6 烷硫基、3 个 C_1-C_6 卤代烷硫基、3 个 C_1-C_6 烷氧基和 3 个 C_1-C_6 卤代烷氧基的基团取代；

R^5 为氢、氰基、硝基、甲酰基、 C_1-C_6 烷基、(C_1-C_6 烷基)羰基或(C_1-C_6 烷氧基)羰基，其中上述基团的脂族基团中的碳原子可以带有 1、2 或 3 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_2-C_6 链烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基和 C_1-C_6 烷硫基的基团的任何组合，或

R^5 为 $C(O)NR^cR^d$ 或 $(SO_2)NR^cR^d$ 、苯基、苯氧基或苄基，后提到的 3 个基团各自可以未被取代或被 1-5 个相互独立地选自 5 个卤素、3 个 C_1-C_6 烷基、3 个 C_1-C_6 卤代烷基、3 个 C_1-C_6 烷硫基、3 个 C_1-C_6 卤代烷硫基、3 个 C_1-C_6 烷氧基和 3 个 C_1-C_6 卤代烷氧基的基团取代；

R^6 为氢、氰基、硝基、 C_1-C_6 烷基、甲酰基、(C_1-C_6 烷基)羰基、(C_1-C_6 烷氧基)羰基、(C_1-C_6 烷硫基)羰基，其中上述基团的脂族基团中的碳原子可以带有 1、2 或 3 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_2-C_6 链烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基和 C_1-C_6 烷硫基的基团的任何组合，或

R^6 为 $C(O)NR^eR^f$ 、 $(SO_2)NR^eR^f$ 、苯基、苯氧基或苄基，后提到的 3 个基团各自可以未被取代或被 1-5 个相互独立地选自 5 个卤素、3 个 C_1-C_6 烷

基、3个 C₁-C₆ 卤代烷基、3个 C₁-C₆ 烷基硫基、3个 C₁-C₆ 卤代烷基硫基、3个 C₁-C₆ 烷基氧基和3个 C₁-C₆ 卤代烷基氧基的基团取代；

R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰ 各自独立地为：

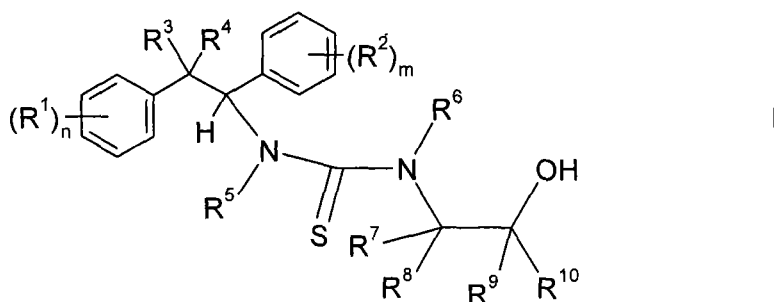
- 氢，
- C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基、C₁-C₆ 烷基氨基、C₁-C₆ 烷基氧基、C₃-C₆ 环烷基，其中这些基团中的碳原子可以带有 1、2 或 3 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷基氧基、C₂-C₆ 链烯氧基、C₂-C₆ 炔氧基、C₁-C₆ 卤代烷基氧基和 C₁-C₆ 烷基硫基的基团的任何组合，
- 苯基或苄基，各自未被取代或被 1-5 个相互独立地选自 5 个卤素、3 个 C₁-C₆ 烷基、3 个 C₁-C₆ 卤代烷基、3 个 C₁-C₆ 烷基硫基、3 个 C₁-C₆ 卤代烷基硫基、3 个 C₁-C₆ 烷基氧基和 3 个 C₁-C₆ 卤代烷基氧基的基团取代；

R^a、R^b、R^c、R^d、R^e、R^f 各自独立地为氢、C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 链烯基或 C₂-C₆ 炔基，其中后 3 个基团中的碳原子可以带有 1、2 或 3 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、巯基、氨基、羧基、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷基氧基、C₂-C₆ 链烯氧基、C₂-C₆ 炔氧基、C₁-C₆ 卤代烷基氧基和 C₁-C₆ 烷基硫基的基团。

因此，本发明涉及式 I 化合物及其盐在对抗动物害虫中的用途以及一种对抗动物害虫的方法，该方法包括使动物害虫，其栖息地，繁殖地，食物供应源，动物害虫生长或可能生长于其中的植物、种子、土壤、区域、材料或环境或需要防止动物侵袭或侵染的材料、植物、种子、土壤、表面或空间与杀虫有效量的至少一种式 I 的 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物和/或至少一种其可农用盐接触。

此外，本发明提供了一种保护作物以防动物害虫，特别是昆虫、蜘蛛或线虫侵袭或侵染的方法，包括使作物与杀虫有效量的至少一种式 I 的 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物和/或至少一种其盐接触。

本发明还涉及新型式 I 的 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物和/或其可农用盐：



其中各变量具有上面对式 I 所定义的含义，
条件是 R^5 和 R^6 不同时为氢。

此外，本发明涉及农用组合物，其优选呈可直接喷雾溶液、乳液、糊、油分散体、粉末、撒播用材料、粉剂形式，或呈颗粒形式，所述组合物包含至少一种如上所定义的式 I 的 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物和/或至少一种其盐，以及与其混合的一种或多种可农用惰性固体或液体载体和需要的话至少一种表面活性剂。

式 I 化合物可以具有一个或多个手性中心，此时它们以立体异构体如对映体或非对映体的混合物存在。本发明提供了纯立体异构体，例如纯对映体或非对映体，及其混合物。式 I 化合物还可以不同互变异构体形式存在。本发明包括单一互变异构体(若可分离的话)，以及互变异构体混合物。

适合于本发明用途的式 I 化合物的盐尤其为可农用盐。它们可以常规方法形成，例如在式 I 化合物具有碱性官能团时通过使该化合物与所述阴离子的酸反应，或使式酸性 I 化合物与合适的碱反应。

合适的可农用盐尤其是其阳离子和阴离子分别对本发明化合物的作用没有任何不利影响的那些阳离子的盐或那些酸的酸加成盐。合适的阳离子尤其是碱金属离子，优选锂、钠和钾离子；碱土金属离子，优选钙、镁和钡离子；过渡金属离子，优选锰、铜、锌和铁离子；还有铵离子(NH_4^+)和其中 1-4 个氢原子被 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 羟基烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、羟基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、苯基和/或苄基代替的取代铵离子。取代铵离子的实例包括甲基铵、异丙基铵、二甲基铵、二异丙基铵、三甲基铵、四甲基铵、四乙基铵、四丁基铵、2-羟基乙基铵、2-(2-羟基乙氧基)乙基铵、二(2-羟基乙基)铵、苄基三甲基铵和苄基三乙基铵，此外还有磷离子，铈离子，优选三($\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基)铈和氧化铈离子，优选三

(C₁-C₄烷基)氧化铀。

有用酸加成盐的阴离子主要是氯离子、溴离子、氟离子、硫酸氢根、硫酸根、磷酸二氢根、磷酸氢根、磷酸根、硝酸根、碳酸氢根、碳酸根、六氟硅酸根、六氟磷酸根、苯甲酸根和 C₁-C₄ 烷酸的阴离子, 优选甲酸根、乙酸根、丙酸根和丁酸根。它们可以通过使式 I 化合物与对应的阴离子的酸, 优选盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸或硝酸反应而形成。

在各变量的上述定义中提到的有机结构部分象术语卤素一样是各基团成员的的各次列举的集合性术语。前缀 C_n-C_m 在每种情况下表示该基团中的可能碳原子数。

术语卤素在每种情况下表示氟、氯、溴或碘, 尤其是氟、氯或溴。

其他含义的实例是:

本文所用以及 C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 烷基氨基、二(C₁-C₆ 烷基)氨基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 烷基磺酰基、C₁-C₆ 烷基亚磺酰基、C₁-C₆ 烷基羰基、C₁-C₆ 烷氧基羰基、C₁-C₆ 烷硫基羰基和 C₁-C₆ 烷基羰基氧基的烷基结构部分中的术语“C₁-C₆ 烷基”指具有 1-6 个碳原子, 尤其是 1-4 个碳原子的饱和直链或支化烃基, 例如甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基、1-乙基-2-甲基丙基、庚基、辛基、2-乙基己基、壬基和癸基及其异构体。C₁-C₄ 烷基例如指甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基或 1,1-二甲基乙基。

本文所用术语“C₁-C₆ 卤代烷基”指具有 1-6 个碳原子的直链或支化饱和烷基(如上所述), 其中这些基团中的部分或所有氢原子可以被上述卤原子代替, 例如 C₁-C₄ 卤代烷基, 如氯甲基、溴甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、1-氯乙基、1-溴乙基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、

2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基等。

本文所用术语“C₁-C₆烷氧基”指经由氧原子连接的具有1-6个碳原子的直链或支化饱和烷基(如上所述)。实例包括C₁-C₆烷氧基,如甲氧基、乙氧基、OCH₂-C₂H₅、OCH(CH₃)₂、正丁氧基、OCH(CH₃)-C₂H₅、OCH₂-CH(CH₃)₂、OC(CH₃)₃、正戊氧基、1-甲基丁氧基、2-甲基丁氧基、3-甲基丁氧基、1,1-二甲基丙氧基、1,2-二甲基丙氧基、2,2-二甲基-丙氧基、1-乙基丙氧基、正己氧基、1-甲基戊氧基、2-甲基戊氧基、3-甲基戊氧基、4-甲基戊氧基、1,1-二甲基丁氧基、1,2-二甲基丁氧基、1,3-二甲基丁氧基、2,2-二甲基丁氧基、2,3-二甲基丁氧基、3,3-二甲基丁氧基、1-乙基丁氧基、2-乙基丁氧基、1,1,2-三甲基丙氧基、1,2,2-三甲基丙氧基、1-乙基-1-甲基丙氧基、1-乙基-2-甲基丙氧基等。

本文所用术语“C₁-C₆卤代烷氧基”指其中氢原子部分或完全被氟、氯、溴和/或碘替代的上述C₁-C₆烷氧基,即例如C₁-C₆卤代烷氧基,如氟代甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氟代甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2-溴乙氧基、2-碘乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、五氟乙氧基、2-氟丙氧基、3-氟丙氧基、2,2-二氟丙氧基、2,3-二氟丙氧基、2-氯丙氧基、3-氯丙氧基、2,3-二氯丙氧基、2-溴丙氧基、3-溴丙氧基、3,3,3-三氟丙氧基、3,3,3-三氯丙氧基、2,2,3,3,3-五氟丙氧基、七氟丙氧基、1-(氟甲基)-2-氟乙氧基、1-(氯甲基)-2-氯乙氧基、1-(溴甲基)-2-溴乙氧基、4-氟丁氧基、4-氯丁氧基、4-溴丁氧基、九氟丁氧基、5-氟-1-戊氧基、5-氯-1-戊氧基、5-溴-1-戊氧基、5-碘-1-戊氧基、5,5,5-三氟-1-戊氧基、十一氟戊氧基、6-氟-1-己氧基、6-氯-1-己氧基、6-溴-1-己氧基、6-碘-1-己氧基、6,6,6-三氟-1-己氧基或十二氟己氧基,尤其是氟代甲氧基、氟代甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基或2,2,2-三氟乙氧基。

本文所用术语“C₁-C₆烷氧基-C₁-C₆烷基”指其中1个碳原子带有上述C₁-C₆烷氧基的C₁-C₆烷基。实例是CH₂-OCH₃、CH₂-OC₂H₅、正丙氧基甲

基、 $\text{CH}_2\text{-OCH}(\text{CH}_3)_2$ 、正丁氧基甲基、(1-甲基丙氧基)甲基、(2-甲基丙氧基)甲基、 $\text{CH}_2\text{-OC}(\text{CH}_3)_3$ 、2-(甲氧基)乙基、2-(乙氧基)乙基、2-(正丙氧基)乙基、2-(1-甲基乙氧基)乙基、2-(正丁氧基)乙基、2-(1-甲基丙氧基)乙基、2-(2-甲基丙氧基)乙基、2-(1,1-二甲基乙氧基)乙基、2-(甲氧基)丙基、2-(乙氧基)丙基、2-(正丙氧基)丙基、2-(1-甲基乙氧基)丙基、2-(正丁氧基)丙基、2-(1-甲基丙氧基)丙基、2-(2-甲基丙氧基)丙基、2-(1,1-二甲基乙氧基)丙基、3-(甲氧基)丙基、3-(乙氧基)丙基、3-(正丙氧基)丙基、3-(1-甲基乙氧基)丙基、3-(正丁氧基)丙基、3-(1-甲基丙氧基)丙基、3-(2-甲基丙氧基)丙基、3-(1,1-二甲基乙氧基)丙基、2-(甲氧基)丁基、2-(乙氧基)丁基、2-(正丙氧基)丁基、2-(1-甲基乙氧基)丁基、2-(正丁氧基)丁基、2-(1-甲基丙氧基)丁基、2-(2-甲基丙氧基)丁基、2-(1,1-二甲基乙氧基)丁基、3-(甲氧基)丁基、3-(乙氧基)丁基、3-(正丙氧基)丁基、3-(1-甲基乙氧基)丁基、3-(正丁氧基)丁基、3-(1-甲基丙氧基)丁基、3-(2-甲基丙氧基)丁基、3-(1,1-二甲基乙氧基)丁基、4-(甲氧基)丁基、4-(乙氧基)丁基、4-(正丙氧基)丁基、4-(1-甲基乙氧基)丁基、4-(正丁氧基)丁基、4-(1-甲基丙氧基)丁基、4-(2-甲基丙氧基)丁基、4-(1,1-二甲基乙氧基)丁基等。

本文所用术语“(C₁-C₆烷基)羰基”指经由在烷基的任何键处的羰基的碳原子键合的具有1-6个碳原子的直链或支化饱和烷基(如上所述)。实例包括C₁-C₆烷基羰基,如CO-CH₃、CO-C₂H₅、正丙基羰基、1-甲基乙基羰基、正丁基羰基、1-甲基丙基羰基、2-甲基丙基羰基、1,1-二甲基乙基羰基、正戊基羰基、1-甲基丁基羰基、2-甲基丁基羰基、3-甲基丁基羰基、1,1-二甲基丙基羰基、1,2-二甲基丙基羰基、2,2-二甲基丙基羰基、1-乙基丙基羰基、正己基羰基、1-甲基戊基羰基、2-甲基戊基羰基、3-甲基戊基羰基、4-甲基戊基羰基、1,1-二甲基丁基羰基、1,2-二甲基丁基羰基、1,3-二甲基丁基羰基、2,2-二甲基丁基羰基、2,3-二甲基丁基羰基、3,3-二甲基丁基羰基、1-乙基丁基羰基、2-乙基丁基羰基、1,1,2-三甲基丙基羰基、1,2,2-三甲基丙基羰基、1-乙基-1-甲基丙基羰基或1-乙基-2-甲基丙基羰基等。

本文所用术语“(C₁-C₆烷氧基)羰基”指经由羰基的碳原子连接的具有1-6个碳原子的直链或支化烷氧基(如上所述),例如CO-OCH₃、CO-OC₂H₅、

COO-CH₂-C₂H₅、CO-OCH(CH₃)₂、正丁氧基羰基、CO-OCH(CH₃)-C₂H₅、CO-OCH₂-CH(CH₃)₂、CO-OC(CH₃)₃、正戊氧基羰基、1-甲基丁氧基羰基、2-甲基丁氧基羰基、3-甲基丁氧基羰基、2,2-二甲基丙氧基羰基、1-乙基丙氧基羰基、正己氧基羰基、1,1-二甲基丙氧基羰基、1,2-二甲基丙氧基羰基、1-甲基戊氧基羰基、2-甲基戊氧基羰基、3-甲基戊氧基羰基、4-甲基戊氧基羰基、1,1-二甲基丁氧基羰基、1,2-二甲基丁氧基羰基、1,3-二甲基丁氧基羰基、2,2-二甲基丁氧基羰基、2,3-二甲基丁氧基羰基、3,3-二甲基丁氧基羰基、1-乙基丁氧基羰基、2-乙基丁氧基羰基、1,1,2-三甲基丙氧基羰基、1,2,2-三甲基丙氧基羰基、1-乙基-1-甲基丙氧基羰基或1-乙基-2-甲基丙氧基羰基。

本文所用术语“(C₁-C₆烷基)羰基氧基”指经由在烷基的任何键处的羰基氧基的碳原子键合的具有1-6个碳原子的直链或支化饱和烷基(如上所述),例如O-CO-CH₃、O-CO-C₂H₅、正丙基羰基氧基、1-甲基乙基羰基氧基、正丁基羰基氧基、1-甲基丙基羰基氧基、2-甲基丙基羰基氧基、1,1-二甲基乙基羰基氧基、正戊基羰基氧基、1-甲基丁基羰基氧基、2-甲基丁基羰基氧基、3-甲基丁基羰基氧基、1,1-二甲基丙基羰基氧基或1,2-二甲基丙基羰基氧基。

本文所用术语“C₁-C₆烷硫基(C₁-C₆烷基硫基: C₁-C₆烷基-S-)”指经由硫原子连接的具有1-6个碳原子的直链或支化饱和烷基(如上所述),例如C₁-C₄烷硫基,如甲硫基、乙硫基、丙硫基、1-甲基乙硫基、丁硫基、1-甲基丙硫基、2-甲基丙硫基、1,1-二甲基乙硫基、正戊硫基羰基、1-甲基丁硫基、2-甲基丁硫基、3-甲基丁硫基、2,2-二甲基丙硫基、1-乙基丙硫基、正己硫基、1,1-二甲基丙硫基、1,2-二甲基丙硫基、1-甲基戊硫基、2-甲基戊硫基、3-甲基戊硫基、4-甲基戊硫基、1,1-二甲基丁硫基、1,2-二甲基丁硫基、1,3-二甲基丁硫基、2,2-二甲基丁硫基、2,3-二甲基丁硫基、3,3-二甲基丁硫基、1-乙基丁硫基、2-乙基丁硫基、1,1,2-三甲基丙硫基、1,2,2-三甲基丙硫基、1-乙基-1-甲基丙硫基或1-乙基-2-甲基丙硫基。

本文所用术语“C₁-C₆烷硫基羰基”指经由羰基的碳原子连接的具有1-6个碳原子的直链或支化烷硫基(如上所述)。实例包括CO-SCH₃、

CO-SC₂H₅、CO-SCH₂-C₂H₅、CO-SCH(CH₃)₂、正丁硫基羰基、CO-SCH(CH₃)-C₂H₅、CO-SCH₂-CH(CH₃)₂、CO-SC(CH₃)₃、正戊硫基羰基、1-甲基丁硫基羰基、2-甲基丁硫基羰基、3-甲基丁硫基羰基、2,2-二甲基丙硫基羰基、1-乙基丙硫基羰基、正己硫基羰基、1,1-二甲基丙硫基羰基、1,2-二甲基丙硫基羰基、1-甲基戊硫基羰基、2-甲基戊硫基羰基、3-甲基戊硫基羰基、4-甲基戊硫基羰基、1,1-二甲基丁硫基羰基、1,2-二甲基丁硫基羰基、1,3-二甲基丁硫基羰基、2,2-二甲基丁硫基羰基、2,3-二甲基丁硫基羰基、3,3-二甲基丁硫基羰基、1-乙基丁硫基羰基、2-乙基丁硫基羰基、1,1,2-三甲基丙硫基羰基、1,2,2-三甲基丙硫基羰基、1-乙基-1-甲基丙硫基羰基或1-乙基-2-甲基丙硫基羰基。

本文所用术语“C₁-C₆烷基亚磺酰基”(C₁-C₆烷基亚磺酰基(sulfoxy)): C₁-C₆烷基-S(=O)-)指经由在烷基的任何键处的亚磺酰基的硫原子键合的具有1-6个碳原子的直链或支化饱和烃基(如上所述),例如SO-CH₃、SO-C₂H₅、正丙基亚磺酰基、1-甲基乙基亚磺酰基、正丁基亚磺酰基、1-甲基丙基亚磺酰基、2-甲基丙基亚磺酰基、1,1-二甲基乙基亚磺酰基、正戊基亚磺酰基、1-甲基丁基亚磺酰基、2-甲基丁基亚磺酰基、3-甲基丁基亚磺酰基、1,1-二甲基丙基亚磺酰基、1,2-二甲基丙基亚磺酰基、2,2-二甲基丙基亚磺酰基、1-乙基丙基亚磺酰基、正己基亚磺酰基、1-甲基戊基亚磺酰基、2-甲基戊基亚磺酰基、3-甲基戊基亚磺酰基、4-甲基戊基亚磺酰基、1,1-二甲基丁基亚磺酰基、1,2-二甲基丁基亚磺酰基、1,3-二甲基丁基亚磺酰基、2,2-二甲基丁基亚磺酰基、2,3-二甲基丁基亚磺酰基、3,3-二甲基丁基亚磺酰基、1-乙基丁基亚磺酰基、2-乙基丁基亚磺酰基、1,1,2-三甲基丙基亚磺酰基、1,2,2-三甲基丙基亚磺酰基、1-乙基-1-甲基丙基亚磺酰基或1-乙基-2-甲基丙基亚磺酰基。

术语“C₁-C₆烷基氨基”指带有一个如上所定义的烷基的仲氨基,例如甲基氨基、乙基氨基、丙基氨基、1-甲基乙基氨基、丁基氨基、1-甲基丙基氨基、2-甲基丙基氨基、1,1-二甲基乙基氨基、戊基氨基、1-甲基丁基氨基、2-甲基丁基氨基、3-甲基丁基氨基、2,2-二甲基丙基氨基、1-乙基丙基氨基、己基氨基、1,1-二甲基丙基氨基、1,2-二甲基丙基氨基、1-甲基戊

基氨基、2-甲基戊基氨基、3-甲基戊基氨基、4-甲基戊基氨基、1,1-二甲基丁基氨基、1,2-二甲基丁基氨基、1,3-二甲基丁基氨基、2,2-二甲基丁基氨基、2,3-二甲基丁基氨基、3,3-二甲基丁基氨基、1-乙基丁基氨基、2-乙基丁基氨基、1,1,2-三甲基丙基氨基、1,2,2-三甲基丙基氨基、1-乙基-1-甲基丙基氨基或1-乙基-2-甲基丙基氨基。

术语“二(C₁-C₆烷基)氨基”指带有两个如上所定义的烷基的叔氨基，例如二甲基氨基、二乙基氨基、二正丙基氨基、二异丙基氨基、N-乙基-N-甲基氨基、N-(正丙基)-N-甲基氨基、N-(异丙基)-N-甲基氨基、N-(正丁基)-N-甲基氨基、N-(正戊基)-N-甲基氨基、N-(2-丁基)-N-甲基氨基、N-(异丁基)-N-甲基氨基、N-(正戊基)-N-甲基氨基、N-(正丙基)-N-乙基氨基、N-(异丙基)-N-乙基氨基、N-(正丁基)-N-乙基氨基、N-(正戊基)-N-乙基氨基、N-(2-丁基)-N-乙基氨基、N-(异丁基)-N-乙基氨基或N-(正戊基)-N-乙基氨基。

本文所用术语“C₁-C₆烷基磺酰基”(C₁-C₆烷基-S(=O)₂-)指经由在烷基的任何键处的磺酰基的硫原子键合的具有1-6个碳原子的直链或支化饱和烷基(如上所述)，例如SO₂-CH₃、SO₂-C₂H₅、正丙基磺酰基、SO₂-CH(CH₃)₂、正丁基磺酰基、1-甲基丙基磺酰基、2-甲基丙基磺酰基、SO₂-C(CH₃)₃、正戊基磺酰基、1-甲基丁基磺酰基、2-甲基丁基磺酰基、3-甲基丁基磺酰基、1,1-二甲基丙基磺酰基、1,2-二甲基丙基磺酰基、2,2-二甲基丙基磺酰基、1-乙基丙基磺酰基、正己基磺酰基、1-甲基戊基磺酰基、2-甲基戊基磺酰基、3-甲基戊基磺酰基、4-甲基戊基磺酰基、1,1-二甲基丁基磺酰基、1,2-二甲基丁基磺酰基、1,3-二甲基丁基磺酰基、2,2-二甲基丁基磺酰基、2,3-二甲基丁基磺酰基、3,3-二甲基丁基磺酰基、1-乙基丁基磺酰基、2-乙基丁基磺酰基、1,1,2-三甲基丙基磺酰基、1,2,2-三甲基丙基磺酰基、1-乙基-1-甲基丙基磺酰基或1-乙基-2-甲基丙基磺酰基。

本文所用以及C₂-C₆链烯氧基、C₂-C₆链烯基氨基、C₂-C₆链烯硫基、C₂-C₆链烯基磺酰基、(C₂-C₆链烯基)羰基、(C₂-C₆链烯氧基)羰基和(C₂-C₆链烯基)羰基氧基的链烯基结构部分中的术语“C₂-C₆链烯基”指具有2-6个碳原子和在任何位置的双键的直链或支化不饱和烃基，如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基

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

本文所用术语“C₂-C₆链烯氧基”指经由氧原子连接的具有2-6个碳原子的直链或支化饱和链烯基(如上所述)，如乙烯氧基、烯丙氧基(丙烯-3-基氧基)、甲代烯丙氧基、丁烯-4-基氧基等。

本文所用术语“C₂-C₆链烯硫基”指经由硫原子连接的具有2-6个碳原子的直链或支化饱和链烯基(如上所述)，如乙烯硫基、烯丙硫基(丙烯-3-基硫基)、甲代烯丙硫基、丁烯-4-基硫基等。

本文所用术语“C₂-C₆链烯基氨基”指经由氮原子连接的具有2-6个碳原子的直链或支化链烯基(如上所述)，如乙烯基氨基、烯丙基氨基(丙烯-3-基氨基)、甲代烯丙基氨基、丁烯-4-基氨基等。

本文所用术语“C₂-C₆链烯基磺酰基”指经由磺酰基(SO₂)连接的具有2-6个碳原子的直链或支化饱和链烯基(如上所述)，如乙烯基磺酰基、烯丙基磺酰基(丙烯-3-基磺酰基)、甲代烯丙基磺酰基、丁烯-4-基磺酰基等。

本文所用以及 C₂-C₆ 炔氧基、C₂-C₆ 炔基氨基、C₂-C₆ 炔硫基、C₂-C₆ 炔基磺酰基、C₂-C₆ 炔基羰基、C₂-C₆ 炔氧基羰基和 C₁-C₆ 炔基羰基氧基的炔基结构部分中的术语“C₂-C₆ 炔基”指具有 2-10 个碳原子且含有至少一个叁键的直链或支化不饱和烃基，如乙炔基、丙-1-炔-1-基、丙-2-炔-1-基、正丁-1-炔-1-基、正丁-1-炔-3-基、正丁-1-炔-4-基、正丁-2-炔-1-基、正戊-1-炔-1-基、正戊-1-炔-3-基、正戊-1-炔-4-基、正戊-1-炔-5-基、正戊-2-炔-1-基、正戊-2-炔-4-基、正戊-2-炔-5-基、3-甲基丁-1-炔-3-基、3-甲基丁-1-炔-4-基、正己-1-炔-1-基、正己-1-炔-3-基、正己-1-炔-4-基、正己-1-炔-5-基、正己-1-炔-6-基、正己-2-炔-1-基、正己-2-炔-4-基、正己-2-炔-5-基、正己-2-炔-6-基、正己-3-炔-1-基、正己-3-炔-2-基、3-甲基戊-1-炔-1-基、3-甲基戊-1-炔-3-基、3-甲基戊-1-炔-4-基、3-甲基戊-1-炔-5-基、4-甲基戊-1-炔-1-基、4-甲基戊-2-炔-4-基或 4-甲基戊-2-炔-5-基等。

本文所用术语“C₂-C₆ 炔氧基”指经由氧原子连接的具有 2-6 个碳原子的直链或支化饱和炔基(如上所述)，如炔丙氧基(丙炔-3-基氧基)、丁炔-3-基氧基和丁炔-4-基氧基。

本文所用术语“C₂-C₆ 炔硫基”指经由硫原子连接的具有 2-6 个碳原子的直链或支化饱和炔基(如上所述)，如炔丙硫基(丙炔-3-基硫基)、丁炔-3-基硫基和丁炔-4-基硫基。

本文所用术语“C₂-C₆ 炔基氨基”指经由氮原子连接的具有 2-6 个碳原子的直链或支化饱和炔基(如上所述)，如炔丙基氨基(丙炔-3-基氨基)、丁炔-3-基氨基和丁炔-4-基氨基。

本文所用术语“C₂-C₆ 炔基磺酰基”指经由磺酰基(SO₂)连接的具有 2-6 个碳原子的直链或支化饱和炔基(如上所述)，如炔丙基磺酰基(丙炔-3-基磺酰基)、丁炔-3-基磺酰基和丁炔-4-基磺酰基。

本文所用术语“C₃-C₁₂ 环烷基”指具有 3-12 个碳原子，尤其是 3-6 个碳原子的单环或双环或多环烃基。单环基团的实例包括环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基和环癸基。双环基团的实例包括双环[2.2.1]庚基、双环[3.1.1]庚基、双环[2.2.2]辛基和双环[3.2.1]壬基。三环基团的实例是金刚烷基和高金刚烷基。

本文所用术语“单环或双环杂芳族环”指具有5或6个环成员的单环杂芳族基团，该基团可以包含稠合的5、6或7员环且因此环成员总数为8-10，其中在每种情况下这些环成员中的1、2、3或4个为相互独立地选自氧、氮和硫的杂原子。该杂环基团可以经由碳环成员或经由氮环成员连接于该分子的其余部分。稠合环包括C₅-C₇环烷基、C₅-C₇环烯基或5-7员杂环基和苯基。

单环5-6员杂芳族环的实例包括三嗪基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、吡啶基、噻吩基、呋喃基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、三唑基、四唑基、噻唑基、噁唑基、噻二唑基、噁二唑基、异噻唑基和异噁唑基。

带有稠合苯基环的5-6员杂芳族环的实例是喹啉基、异喹啉基、吲哚基、中氮茛基、异吲哚基、吲唑基、苯并呋喃基、苯并噻吩基、苯并[b]噻唑基、苯并噁唑基、苯并噻唑基、苯并噁唑基和苯并咪唑基。带有稠合环烯基环的5-6员杂芳族环的实例是二氢吲哚基、二氢中氮茛基、二氢异吲哚基、二氢喹啉基、二氢异喹啉基、苯并吡喃基、苯并二氢吡喃基等。

术语“5-7员杂环基”包括如上所定义的单环杂芳族环和具有5、6或7个环成员的非芳族饱和或部分不饱和杂环。非芳族环的实例包括吡咯烷基、吡唑啉基、咪唑啉基、吡咯啉基、吡唑啉基、咪唑啉基、四氢呋喃基、二氢呋喃基、1,3-二氧戊环基、二氧环戊烯基(dioxolenyl)、硫杂戊环基(thiolanyl)、二氢噻吩基、噁唑烷基、异噁唑烷基、噁唑啉基、异噁唑啉基、噻唑啉基、异噻唑啉基、噻唑烷基、异噻唑烷基、氧硫杂戊环基(oxathiolanyl)、哌啶基、哌嗪基、吡喃基、二氢吡喃基、四氢吡喃基、二噁烷基、噻喃基、二氢噻喃基、四氢噻喃基、吗啉基、噻嗪基等。

考虑到式I化合物的杀虫活性，优选其中各变量相互独立地或与任何其他变量相结合地具有下列含义的那些式I化合物：

n为1、2或3；

m为1、2或3；

m+n为2、3、4或5，尤其是3、4或5；

R¹为卤素、OH、SH、NH₂、SO₃H、COOH、氰基、硝基、甲酰基、

可以带有1-3个卤素的C₁-C₄烷基、可以带有1-3个卤素的C₁-C₄烷氧

基、 C_1 - C_6 烷基氨基、(C_1 - C_6 烷氧基)羰基或苯基，其中苯基未被取代或被1-5个相互独立地选自5个卤素、3个 C_1 - C_6 烷基、3个 C_1 - C_6 卤代烷基、3个 C_1 - C_6 烷硫基、3个 C_1 - C_6 卤代烷硫基、3个 C_1 - C_6 烷氧基和3个 C_1 - C_6 卤代烷氧基的基团取代，

尤其是氟、氯、溴、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、二氟甲基、三氟甲基、二氟甲氧基、三氟甲氧基或苯基，其中苯基可以未被取代或可以带有1、2或3个选自卤素和/或甲基的基团；

R^2 为卤素、OH、SH、 NH_2 、 SO_3H 、COOH、氰基、硝基、甲酰基、

可以带有1-3个卤素的 C_1 - C_4 烷基、可以带有1-3个卤素的 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_6 烷基氨基、(C_1 - C_6 烷氧基)羰基或苯基，其中苯基未被取代或被1-5个相互独立地选自5个卤素、3个 C_1 - C_6 烷基、3个 C_1 - C_6 卤代烷基、3个 C_1 - C_6 烷硫基、3个 C_1 - C_6 卤代烷硫基、3个 C_1 - C_6 烷氧基和3个 C_1 - C_6 卤代烷氧基的基团取代，

尤其是氟、氯、溴、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、二氟甲基、三氟甲基、二氟甲氧基、三氟甲氧基或苯基，其中苯基可以未被取代或可以带有1、2或3个选自卤素和/或甲基的基团；

R^3 为氢或 C_1 - C_4 烷基，尤其是氢或甲基，最优选氢；

R^4 为氢、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基或苯基，

其中苯基未被取代或被1-5个相互独立地选自5个卤素、3个 C_1 - C_6 烷基、3个 C_1 - C_6 卤代烷基、3个 C_1 - C_6 烷硫基、3个 C_1 - C_6 卤代烷硫基、3个 C_1 - C_6 烷氧基和 C_1 - C_6 卤代烷氧基的基团取代；

R^5 为氢、氰基、甲酰基、 C_1 - C_4 烷基、(C_1 - C_6 烷基)羰基、(C_1 - C_4 卤代烷基)羰基、(C_1 - C_6 烷氧基)羰基、 C_1 - C_4 烷氧基-(C_1 - C_4 烷氧基)羰基或(C_1 - C_6 烷硫基)羰基，尤其是氢；

R^6 为氢、氰基、甲酰基、 C_1 - C_4 烷基、(C_1 - C_6 烷基)羰基、(C_1 - C_4 卤代烷基)羰基、(C_1 - C_6 烷氧基)羰基、 C_1 - C_4 烷氧基-(C_1 - C_4 烷氧基)羰基或(C_1 - C_6 烷硫基)羰基，尤其是氢；

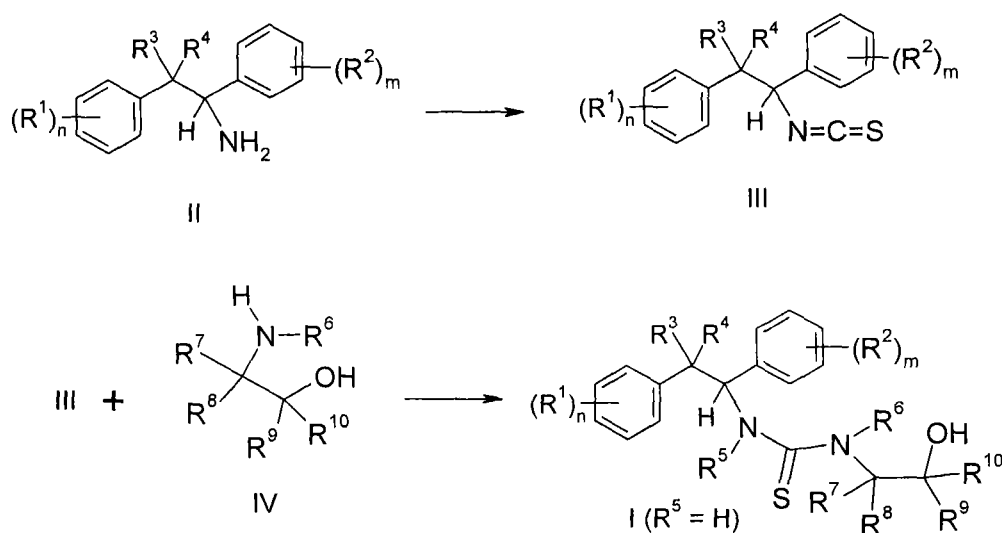
R^7 、 R^8 、 R^9 和 R^{10} 各自为氢，或者这些基团之一还可以为 C_1 - C_4 烷基。

在本发明的非常优选实施方案中，基团 R^3 和 R^4 均为氢。在本发明的

另一优选实施方案中， R^3 为氢且 R^4 为 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基或苯基，其中苯基未被取代或被 1-5 个相互独立地选自 5 个卤素、3 个 C_1 - C_6 烷基、3 个 C_1 - C_6 卤代烷基、3 个 C_1 - C_6 烷硫基、3 个 C_1 - C_6 卤代烷硫基、3 个 C_1 - C_6 烷氧基和 3 个 C_1 - C_6 卤代烷氧基的基团取代。在该实施方案中， R^4 优选为甲基、乙基或尤其是未取代或取代的苯基。

本发明的另一实施方案涉及其中基团 R^7 、 R^8 、 R^9 和 R^{10} 中的至少一个，优选 1 或 2 个不为氢的式 I 化合物。此时，优选其中基团 R^7 、 R^8 、 R^9 或 R^{10} 中的 1 或 2 个选自 C_1 - C_4 烷基、任选取代的苯基或任选取代的苄基的式 I 化合物。

本发明的化合物例如可以由对应的二苯基乙基胺 II 通过下列方案所示合成途径制备：



根据该方案中所示方法，通过常规方法将 1,2-二苯基氨基乙烷 II 转化成对应的异硫氰酸酯 III，例如通过使 II 与硫光气反应(例如参见 Houben-Weyl, E4, “Methoden der Organischen Chemie”, 第 IIIc 章, 第 837-842 页, Georg Thieme Verlag 1983。然后使异硫氰酸酯 III 与式 IV 的氨基乙醇反应，从而得到其中 R^5 为氢的式 I 的 1-(1,2-二苯基乙基)-3-(2-羟基乙基)硫脲化合物。

氨基乙醇 IV 与异硫氰酸酯 III 的反应可以按照有机化学的标准方法进行，例如参见 Biosci. Biotech. Biochem. 56(7), 1062-1065(1992)。

式 II 的二苯基乙基胺在本领域是已知的(例如 1,2-二苯基乙基胺, CAS 号[3082-58-4])，或者它们可以由有机化学人员熟知并且在本领域众所周知

的方法制备。制备二苯基乙基胺 II 的合适方法尤其包括对应的苯基苄基酮的还原性胺化或对应的苯基苄基肟的还原(例如参见 J. Med. Chem. 38, 1600-1607(1995)或 J. Med. Chem. 37(7), 913-923(1994))。式 II 的二苯基乙基胺还可以通过根据 Tetrahedron 55, 第 8883-8904 页(1999)所述的方法将苯基-或苄基-有机金属试剂加成到合适的亚胺如苯甲醛化合物或 2-苯基乙醛化合物的叔丁基亚磺酰基亚胺上而制备。

2-氨基乙醇化合物 IV 可以市购或者可以根据有机化学人员熟知的常规方法制备。

R⁵ 具有氢以外的含义的化合物 I 例如可以通过用酰化试剂或烷基化试剂如碘甲烷处理其中 R⁵ 为氢的化合物 I 而制备(例如参见 J. Pharm. Sci. 59, 1515-1518(1970))。

由于其优异的活性, 式 I 化合物可以用于控制选自有害昆虫、蜘蛛和线虫的动物害虫。因此, 本发明进一步提供了对抗该类动物害虫的农用组合物, 其包含具有杀虫作用的量的至少一种通式 I 化合物或至少一种 I 的可农用盐以及至少一种惰性液体和/或固体可农用载体, 以及需要的话至少一种表面活性剂。

该类组合物可以含有单一的式 I 的活性化合物或几种本发明活性化合物 I 的混合物。本发明的组合物可以包含单一的异构体或异构体混合物以及单独的互变异构体或互变异构体混合物。

式 I 化合物以及包含它们的杀虫组合物是用于控制选自昆虫、蜘蛛和线虫的动物害虫的有效试剂。由式 I 化合物控制的动物害虫例如包括: 鳞翅目昆虫(鳞翅目(Lepidoptera)), 例如小地老虎(*Agrotis ypsilon*)、黄地老虎(*Agrotis segetum*)、木棉虫(*Alabama argillacea*)、黎豆夜蛾(*Anticarsia gemmatalis*)、*Argyresthia conjugella*、叉纹夜蛾(*Autographa gamma*)、树尺蠖(*Bupalus piniarius*)、*Cacoecia murinana*、*Capua reticulana*、*Cheimatobia brumata*、云杉色卷蛾(*Choristoneura fumiferana*)、*Choristoneura occidentalis*、二化螟(*Cirphis unipuncta*)、苹果小卷蛾(*Cydia pomonella*)、松毛虫(*Dendrolimus pini*)、*Diaphania nitidalis*、西南玉米秆草螟(*Diatraea grandiosella*)、埃及钻夜蛾(*Earias insulana*)、南美玉米苗斑

螟(*Elasmopalpus lignosellus*)、女贞细卷蛾(*Eupoecilia ambiguella*)、*Evetria bouliana*、*Feltia subterranea*、蜡螟(*Galleria mellonella*)、李小食心虫(*Grapholitha funebrana*)、梨小食心虫(*Grapholitha molesta*)、棉铃虫(*Heliothis armigera*)、烟芽夜蛾(*Heliothis virescens*)、玉米穗虫(*Heliothis zea*)、菜螟(*Hellula undalis*)、*Hibernia defoliaria*、美国白蛾(*Hyphantria cunea*)、苹果巢蛾(*Hyponomeuta malinellus*)、番茄虫蛾(*Keiferia lycopersicella*)、*Lambdina fiscellaria*、甜菜夜蛾(*Laphygma exigua*)、咖啡潜叶蛾(*Leucoptera coffeella*)、旋纹潜蛾(*Leucoptera scitella*)、*Lithocolletis blancardella*、葡萄浆果小卷蛾(*Lobesia botrana*)、甜菜网螟(*Loxostege sticticalis*)、舞毒蛾(*Lymantria dispar*)、模毒蛾(*Lymantria monacha*)、桃潜蛾(*Lyonetia clerkella*)、黄褐天幕毛虫(*Malacosoma neustria*)、甘蓝夜蛾(*Mamestra brassicae*)、黄杉毒蛾(*Orgyia pseudotsugata*)、玉米螟(*Ostrinia nubilalis*)、小眼夜蛾(*Panolis flammea*)、棉花红铃虫(*Pectinophora gossypiella*)、疆夜蛾(*Peridroma saucia*)、圆掌舟蛾(*Phalera bucephala*)、马铃薯麦蛾(*Phthorimaea operculella*)、柑桔潜叶蛾(*Phyllocnistis citrella*)、欧洲粉蝶(*Pieris brassicae*)、苜蓿绿夜蛾(*Plathypena scabra*)、菜蛾(*Plutella xylostella*)、大豆夜蛾(*Pseudoplusia includens*)、*Rhyacionia frustrana*、*Scrobipalpus absoluta*、麦蛾(*Sitotroga cerealella*)、葡萄卷叶蛾(*Sparganothis pilleriana*)、草地夜蛾(*Spodoptera frugiperda*)、海灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis*)、斜纹夜蛾(*Spodoptera litura*)、*Thaumatopoea pityocampa*、绿色橡木飞蛾(*Tortrix viridana*)、粉纹夜蛾(*Trichoplusia ni*)和 *Zeiraphera canadensis*;

甲虫(鞘翅目(*Coleoptera*)), 例如梨窄吉丁(*Agrilus sinuatus*)、直条叩头虫(*Agriotes lineatus*)、暗色叩头虫(*Agriotes obscurus*)、*Amphimallus solstitialis*、*Anisandrus dispar*、墨西哥棉铃象(*Anthonomus grandis*)、苹花象(*Anthonomus pomorum*)、甜菜隐食甲(*Atomaria linearis*)、纵坑切梢小蠹(*Blastophagus piniperda*)、*Blitophaga undata*、蚕豆象(*Bruchus rufimanus*)、豌豆象(*Bruchus pisorum*)、欧洲兵豆象(*Bruchus lentis*)、苹卷象(*Byctiscus betulae*)、甜菜大龟甲(*Cassida nebulosa*)、*Cerotoma*

trifurcata、白菜籽龟象 (*Ceuthorrhynchus assimilis*)、芜菁龟象 (*Ceuthorrhynchus napi*)、甜菜胫跳甲 (*Chaetocnema tibialis*)、*Conoderus vespertinus*、石刁柏负泥虫 (*Crioceris asparagi*)、长角叶甲 (*Diabrotica longicornis*)、*Diabrotica 12-punctata*、玉米根叶甲 (*Diabrotica virgifera*)、墨西哥豆瓢虫 (*Epilachna varivestis*)、烟草跳甲 (*Epitrix hirtipennis*)、棉灰蒙象变种 (*Eutinobothrus brasiliensis*)、欧洲松树皮象 (*Hylobius abietis*)、埃及苜蓿叶象 (*Hypera brunneipennis*)、紫苜蓿叶象 (*Hypera postica*)、云杉八齿小蠹 (*Ips typographus*)、烟草负泥虫 (*Lema bilineata*)、黑角负泥虫 (*Lema melanopus*)、马铃薯叶甲 (*Leptinotarsa decemlineata*)、*Limonius californicus*、稻水象甲 (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、*Melanotus communis*、油菜露尾甲 (*Meligethes aeneus*)、大栗鳃金龟 (*Melolontha hippocastani*)、五月鳃金龟 (*Melolontha melolontha*)、水稻负泥虫 (*Oulema oryzae*)、葡萄黑耳喙象 (*Ortiorrhynchus sulcatus*)、草莓根象甲 (*Otiorrhynchus ovatus*)、辣根猿叶甲 (*Phaedon cochleariae*)、*Phyllotreta chrysocephala*、食叶鳃金龟属 (*Phyllophaga* sp.)、庭园发丽金龟 (*Phyllopertha horticola*)、大豆淡足跳甲 (*Phyllotreta nemorum*)、黄曲条菜跳甲 (*Phyllotreta striolata*)、日本金龟子 (*Popillia japonica*)、豌豆叶象 (*Sitona lineatus*) 和谷象 (*Sitophilus granaria*);

双翅目昆虫(双翅目(Diptera)), 例如埃及伊蚊(*Aedes aegypti*)、刺扰伊蚊 (*Aedes vexans*)、墨西哥果蝇 (*Anastrepha ludens*)、五斑按蚊 (*Anopheles maculipennis*)、地中海实蝇 (*Ceratitis capitata*)、蛆症金蝇 (*Chrysomya bezziana*)、*Chrysomya hominivorax*、*Chrysomya macellaria*、高粱瘿蚊 (*Contarinia sorghicola*)、*Cordylobia anthropophaga*、尖音库蚊 (*Culex pipiens*)、瓜蝇 (*Dacus cucurbitae*)、油橄榄实蝇 (*Dacus oleae*)、油菜叶瘿蚊 (*Dasineura brassicae*)、小毛厕蝇 (*Fannia canicularis*)、马蝇 (*Gasterophilus intestinalis*)、刺舌蝇 (*Glossina morsitans*)、*Haematobia irritans*、*Haplodiplosis equestris*、花生田灰地种蝇 (*Hylemyia platura*)、纹皮蝇 (*Hypoderma lineata*)、蔬菜斑潜蝇 (*Liriomyza sativae*)、美国潜叶蝇 (*Liriomyza trifolii*)、*Lucilia caprina*、铜绿蝇 (*Lucilia cuprina*)、丝光绿蝇

(*Lucilia sericata*)、*Lycoria pectoralis*、麦瘿蚊(*Mayetiola destructor*)、家蝇(*Musca domestica*)、厩腐蝇(*Muscina stabulans*)、羊狂蝇(*Oestrus ovis*)、欧洲麦秆蝇(*Oscinella frit*)、天仙子泉蝇(*Pegomya hysocyami*)、*Phorbia antiqua*、萝卜蝇(*Phorbia brassicae*)、*Phorbia coarctata*、樱桃实蝇(*Rhagoletis cerasi*)、苹果实蝇(*Rhagoletis pomonella*)、*Tabanus bovinus*、*Tipula oleracea* 和欧洲大蚊(*Tipula paludosa*);

蓟马(缨翅目(*Thysanoptera*)), 例如兰花蓟马(*Dichromothrips corbetti*)、烟褐蓟马(*Frankliniella fusca*)、苜蓿花蓟马(*Frankliniella occidentalis*)、东方花蓟马(*Frankliniella tritici*)、桔硬蓟马(*Scirtothrips citri*)、稻蓟马(*Thrips oryzae*)、棕榈蓟马(*Thrips palmi*)和烟蓟马(*Thrips tabaci*),

膜翅目昆虫(膜翅目(*Hymenoptera*)), 例如新疆菜叶蜂(*Athalia rosae*)、切叶蚁(*Atta cephalotes*)、*Atta sexdens*、*Atta texana*、*Hoplocampa minuta*、*Hoplocampa testudinea*、小黄家蚁(*Monomorium pharaonis*)、热带火蚁(*Solenopsis geminate*)和红火蚁(*Solenopsis invicta*),

异翅目昆虫(异翅目(*Heteroptera*)), 例如拟绿蝽(*Acrosternum hilare*)、玉米长蝽(*Blissus leucopterus*)、黑斑烟盲蝽(*Cyrtopeltis notatus*)、棉红蝽(*Dysdercus cingulatus*)、*Dysdercus intermedius*、麦扁盾蝽(*Eurygaster integriceps*)、*Euschistus impictiventris*、棉红铃喙缘蝽(*Leptoglossus phyllopus*)、美洲牧草盲蝽(*Lygus lineolaris*)、牧草盲蝽(*Lygus pratensis*)、稻绿蝽(*Nezara viridula*)、甜菜拟网蝽(*Piesma quadrata*)、*Solubea insularis* 和 *Thyanta perditor*;

同翅目昆虫(同翅目(*Homoptera*)), 例如 *Acyrtosiphon onobrychis*、落叶松球蚜(*Adelges laricis*)、*Aphidula nasturtii*、蚕豆蚜(*Aphis fabae*)、草莓根蚜(*Aphis forbesi*)、苹果蚜(*Aphis pomi*)、棉蚜(*Aphis gossypii*)、北美茶藨子蚜(*Aphis grossulariae*)、*Aphis schneideri*、卷叶蚜(*Aphis spiraeicola*)、*Aphis sambuci*、豌豆蚜(*Acyrtosiphon pisum*)、马铃薯蚜(*Aulacorthum solani*)、银叶粉虱(*Bemisia argentifolii*)、*Brachycaudus cardui*、杏圆尾蚜(*Brachycaudus helichrysi*)、*Brachycaudus persicae*、*Brachycaudus prunicola*、甘蓝蚜(*Brevicoryne brassicae*)、*Capitophorus horni*、*Cerosipha*

gossypii、*Chaetosiphon fragaefolii*、*Cryptomyzus ribis*、高加索冷杉椎球蚜(*Dreyfusia nordmannianae*)、云杉椎球蚜(*Dreyfusia piceae*)、居根西圆尾蚜(*Dysaphis radicola*)、*Dysaulacorthum pseudosolani*、*Dysaphis plantaginea*、*Dysaphis pyri*、蚕豆微叶蝉(*Empoasca fabae*)、桃大尾蚜(*Hyalopterus pruni*)、*Hyperomyzus lactucae*、麦长管蚜(*Macrosiphum avenae*)、大戟长管蚜(*Macrosiphum euphorbiae*)、蔷薇管蚜(*Macrosiphon rosae*)、*Megoura viciae*、巢菜修尾蚜(*Melanaphis pyrarius*)、麦无网蚜(*Metopolophium dirhodum*)、*Myzodes persicae*、冬葱瘤额蚜(*Myzus ascalonicus*)、*Myzus cerasi*、桃蚜(*Myzus persicae*)、李瘤蚜(*Myzus varians*)、*Nasonovia ribis-nigri*、稻飞虱(*Nilaparvata lugens*)、囊柄瘿绵蚜(*Pemphigus bursarius*)、蔗飞虱(*Perkinsiella saccharicida*)、忽布疣蚜(*Phorodon humuli*)、苹木虱(*Psylla mali*)、梨木虱(*Psylla piri*)、冬葱瘤蛾蚜(*Rhopalomyzus ascalonicus*)、玉米蚜(*Rhopalosiphum maidis*)、禾谷溢管蚜(*Rhopalosiphum padi*)、*Rhopalosiphum insertum*、*Sappaphis mala*、*Sappaphis mali*、麦二叉蚜(*Schizaphis graminum*)、*Schizoneura lanuginosa*、麦长管蚜(*Sitobion avenae*)、白背飞虱(*Sogatella furcifera*)、白粉虱(*Trialeurodes vaporariorum*)、*Toxoptera aurantiiand* 和葡萄根瘤蚜(*Viteus vitifolii*);

白蚁(等翅目(*Isoptera*)), 例如 *Calotermes flavicollis*、*Leucotermes flavipes*、黄肢散白蚁(*Reticulitermes flavipes*)、欧洲散白蚁(*Reticulitermes lucifugus*) 和 *Termes natalensis*;

直翅目昆虫(直翅目(*Orthoptera*)), 例如居屋艾蟋(*Acheta domestica*)、东方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、德国小蠊(*Blattella germanica*)、欧洲球蝮(*Forficula auricularia*)、蝼蛄(*Gryllotalpa gryllotalpa*)、飞蝗(*Locusta migratoria*)、双纹黑蝗(*Melanoplus bivittatus*)、红足黑蝗(*Melanoplus femur-rubrum*)、墨西哥黑蝗(*Melanoplus mexicanus*)、迁飞黑蝗(*Melanoplus sanguinipes*)、石栖黑蝗(*Melanoplus spretus*)、条纹红蝗(*Nomadacris septemfasciata*)、美洲蟑螂(*Periplaneta americana*)、美洲沙漠蝗(*Schistocerca americana*)、*Schistocerca peregrina*、*Stauronotus maroccanus* 和庭疾灶螽(*Tachycines*

asynamorus);

蜘蛛纲(Arachnoidea), 如蜘蛛(蜱螨目(Acarina)), 例如软蜱科(Argasidae)、蜱科(Ixodidae)和疥螨科(Sarcoptidae), 如长星形壁虱(Amblyomma americanum)、热带花蜱(Amblyomma variegatum)、波斯锐缘蜱(Argas persicus)、牛壁虱(Boophilus annulatus)、Boophilus decoloratus、微小牛蜱(Boophilus microplus)、Dermacentor silvarum、Hyalomma truncatum、蓖子硬蜱(Ixodes ricinus)、Ixodes rubicundus、Ornithodoros moubata、Otobius megnini、鸡皮刺螨(Dermanyssus gallinae)、绵羊疥病(Psoroptes ovis)、Rhipicephalus appendiculatus、Rhipicephalus evertsi、人疥螨(Sarcoptes scabiei), 瘿螨属(Eriophyidae spp.), 如苹果刺锈螨(Aculus schlechtendali)、Phyllocoptrata oleivora 和 Eriophyes sheldoni; 细螨属(Tarsonemidae spp.), 如 Phytionemus pallidus 和侧多食跗线螨(Polyphagotarsonemus latus); 细须螨属(Tenuipalpidae spp.), 如紫红短须螨(Brevipalpus phoenicis); 叶螨属(Tetranychidae spp.), 如朱砂叶螨(Tetranychus cinnabarinus)、神泽叶螨(Tetranychus kanzawai)、太平洋叶螨(Tetranychus pacificus)、棉叶螨(Tetranychus telarius)和二点叶螨(Tetranychus urticae), 苹果叶螨(Panonychus ulmi)、柑桔叶螨(Panonychus citri)和 oligonychus pratensis;

蚤目(Siphonatera), 例如 Xenopsylla cheopsis、角叶(Ceratophyllus)属;

组合物和式 I 化合物可以用于控制线虫, 尤其是植物寄生线虫如根结线虫, 北方根结线虫(Meloidogyne hapla)、南方根结线虫(Meloidogyne incognita)、爪哇根结线虫(Meloidogyne javanica)和其他根结线虫属(Meloidogyne); 形成孢囊的线虫, 马铃薯金线虫(Globodera rostochiensis)和其他球孢囊属(Globodera); 禾谷孢囊线虫(Heterodera avenae)、大豆孢囊线虫(Heterodera glycines)、甜菜孢囊线虫(Heterodera schachtii)、三叶草孢囊线虫(Heterodera trifolii)和其他孢囊线虫属(Heterodera); 种子肿瘤线虫, 粒线虫属(Anguina); 茎叶线虫, 滑刃线虫属(Aphelenchoides); 刺线虫, 杂草刺线虫(Belonolaimus longicaudatus)和其他针刺线虫属(Belonolaimus); 松线虫, 松材线虫(Bursaphelenchus xylophilus)和其他伞

滑刃线虫属(*Bursaphelenchus*); 环形线虫, 环纹线虫属(*Criconema*)、小环线虫属(*Criconemella*)、轮线虫属(*Criconemoides*)、中环线虫属(*Mesocriconema*); 球茎线虫, 腐烂茎线虫(*Ditylenchus destructor*)、甘薯茎线虫(*Ditylenchus dipsaci*)和其他茎线虫属(*Ditylenchus*); 锥线虫, 锥线虫属(*Dolichodorus*); 螺旋形线虫, *Helicotylenchus multicinctus* 和其他 *Helicotylenchus* 属; 鞘线虫和鞘形 (*sheathoid*) 线虫, 鞘线虫属(*Hemicycliophora*)和 *Hemicriconemoides* 属; *Hirshmanniella* 属; 冠线虫, *Hoploaimus* 属; 伪根结线虫, 珍珠线虫属(*Nacobbus*); 针线虫, *Longidorus elongatus* 和其他长针线虫属(*Longidorus*); 针线虫, 针线虫属(*Paratylenchus*); 根腐线虫, *Pratylenchus neglectus*、穿刺根腐线虫(*Pratylenchus penetrans*)、*Pratylenchus curvatus*、*Pratylenchus goodeyi* 和其他根腐线虫属(*Pratylenchus*); 穿孔线虫, 香蕉穿孔线虫(*Radopholus similis*)和其他穿孔线虫属(*Radopholus*); 肾形线虫, *Rotylenchus robustus* 和其他盘旋线虫属(*Rotylenchus*); *Scutellonema* 属; 残根线虫, *Trichodorus primitivus* 和其他毛刺线虫属(*Trichodorus*)、拟毛刺属(*Paratrichodorus*); 阻长线虫, *Tylenchorhynchus claytoni*、*Tylenchorhynchus dubius* 和其他矮化线虫属(*Tylenchorhynchus*); 柑桔线虫, 垫刃线虫属(*Tylenchulus*); 剑线虫, 剑线虫属(*Xiphinema*); 以及其他植物寄生线虫属。

在本发明的优选实施方案中, 将式 I 化合物用于控制昆虫或蜘蛛, 尤其是鳞翅目、鞘翅目和同翅目昆虫以及蜱螨目蜘蛛。本发明的式 I 化合物特别可以用于控制鳞翅目和同翅目昆虫。

式 I 化合物或包含它们的杀虫组合物可以用于保护生长的植物和作物以防动物害虫, 尤其是昆虫、粉螨或蜘蛛或的侵袭或侵染, 其中使植物/作物与杀虫有效量的式 I 化合物接触。术语“作物”指生长的作物和收获的作物二者。

对于本发明的应用, 可以将化合物 I 转化成常规配制剂, 例如溶液、乳液、悬浮液、粉剂、粉末、糊和颗粒。使用形式取决于特定的目的; 在任何情况下意欲确保本发明化合物精细和均匀地分布。

用于对抗动物害虫, 即昆虫、蜘蛛或线虫的杀虫组合物含有该量的至

少一种通式 I 化合物或 I 的可农用盐和常用于配制杀虫组合物的助剂。

配制剂以已知方式制备，例如通过将活性成分与溶剂和/或载体混合而制备，若需要的话使用乳化剂和分散剂。合适的溶剂/助剂主要为：

- 水、芳族溶剂(如 Solvesso 产品、二甲苯)、石蜡(如矿物油馏分)、醇类(如甲醇、丁醇、戊醇、苜醇)、酮类(如环己酮、 γ -丁内酯)、吡咯烷酮(NMP、NOP)、乙酸酯(乙二醇二乙酸酯)、二元醇、脂肪酸二甲基酰胺、脂肪酸及脂肪酸酯。原则上还可以使用溶剂混合物。
- 载体如磨碎的天然矿物(如高岭土、粘土、滑石、白垩)和磨碎的合成矿物(如高度分散的硅石、硅酸盐)；乳化剂如非离子和阴离子乳化剂(如聚氧乙烯脂肪醇醚、烷基磺酸盐和芳基磺酸盐)以及分散剂如木素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

合适的表面活性剂是木素磺酸、萘磺酸、苯酚磺酸、二丁基萘磺酸的碱金属盐、碱土金属盐和铵盐，烷基芳基磺酸盐，烷基硫酸盐，烷基磺酸盐，脂肪醇硫酸盐，脂肪酸和硫酸化脂肪醇乙二醇醚，还有磺化萘和萘衍生物与甲醛的缩合物，萘或萘磺酸与苯酚和甲醛的缩合物，聚氧乙烯辛基苯基醚，乙氧基化的异辛基酚、辛基酚、壬基酚，烷基苯基聚乙二醇醚，三丁基苯基聚乙二醇醚，三硬脂基苯基聚乙二醇醚，烷基芳基聚醚醇，醇和脂肪醇/氧化乙烯缩合物，乙氧基化蓖麻油，聚氧乙烯烷基醚，乙氧基化聚氧丙烯，月桂醇聚乙二醇醚缩醛，山梨醇酯，木素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

适于制备可直接喷雾溶液、乳液、糊或油分散体的物质是中沸点到高沸点的矿物油馏分，如煤油或柴油，此外还有煤焦油和植物或动物来源的油，脂族、环状和芳族烃，例如苯、甲苯、二甲苯、石蜡、四氯化萘、烷基化萘或其衍生物、甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、氯仿、四氯化碳、环己醇、环己酮、氯苯、异佛尔酮，强极性溶剂，例如二甲基甲酰胺、二甲亚砷、N-甲基吡咯烷酮和水。

粉末、撒播用材料和粉剂可以通过将活性物质与固体载体混合或同时研磨而制备。

颗粒如涂覆颗粒、压实颗粒、浸渍颗粒和均质颗粒可以通过将活性成分与固体载体粘附而制备。固体载体的实例是矿土如硅石、硅胶、硅酸盐、滑石、高岭土、活性粘土(attaclay)、石灰石、石灰、白垩、红玄武土、黄土、粘土、白云石、硅藻土、硫酸钙、硫酸镁、氧化镁；磨碎的合成材料；肥料如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、尿素；植物来源的产品如谷粉、树皮粉、木粉和坚果壳粉，纤维素粉和其它固体载体。

本发明的该类配制剂或组合物包括与一种或多种可农用的惰性固体或液体载体混合的本发明式 I 化合物(或其组合)。这些组合物含有杀虫有效量的所述化合物，该量可以随特定化合物、目标害虫和使用方法而变化。

配制剂通常包含 0.01-95 重量%，优选 0.1-90 重量%的活性成分。活性成分以 90-100%，优选 95-100%的纯度(根据 NMR 谱)使用。

下列为配制剂实例：

1. 叶面施用的用水稀释的产品。对于种子处理目的，该产品可以稀释或不稀释地施用于种子。

A) 水溶性浓缩物(SL、LS)

将 10 重量份活性化合物溶于 90 重量份水或水溶性溶剂中。或者，加入湿润剂或其它助剂。活性化合物经水稀释溶解，从而得到含 10 重量%活性化合物的配制剂。

B) 分散性浓缩物(DC)

将 20 重量份活性化合物溶于 70 重量份环己酮中并加入 10 重量份分散剂如聚乙烯基吡咯烷酮。用水稀释得到分散体，从而得到含有 20 重量%活性化合物的配制剂。

C) 乳油(EC)

将 15 重量份活性化合物溶于 7 重量份二甲苯中并加入十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物(在每种情况下为重量份)。用水稀释得到乳液，从而得到含有 15 重量%活性化合物的配制剂。

D) 乳液(EW、EO、ES)

将 25 重量份活性化合物溶于 35 重量份二甲苯中并加入十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物(在每种情况下为 5 重量份)。借助乳化机(Ultraturrax)

将该混合物引入 30 重量份水中并制成均匀乳液。用水稀释得到乳液，从而得到含有 25 重量%活性化合物的配制剂。

E) 悬浮液(SC、OD、FS)

在搅拌的球磨机中，将 20 重量份活性化合物粉碎并加入 10 重量份分散剂、湿润剂和 70 重量份水或有机溶剂，得到微细活性化合物悬浮液。用水稀释得到稳定的活性化合物悬浮液，从而得到含有 20 重量%活性化合物的配制剂。

F) 水分散性颗粒和水溶性颗粒(WG、SG)

将 50 重量份活性化合物精细研磨并加入 50 重量份分散剂和湿润剂，借助工业装置(如挤出机、喷雾塔、流化床)将其制成水分散性或水溶性颗粒。用水稀释得到稳定的活性化合物分散体或溶液，从而得到含有 50 重量%活性化合物的配制剂。

G) 水分散性粉末和水溶性粉末(WP、SP、SS、WS)

将 75 重量份活性化合物在转子-定子磨机中研磨并加入 25 重量份分散剂、湿润剂和硅胶。用水稀释得到稳定的活性化合物分散体或溶液，从而得到含有 75 重量%活性化合物的配制剂。

H) 凝胶配制剂(GF)

在搅拌的球磨机中，将 20 重量份活性化合物粉碎，加入 10 重量份分散剂、1 重量份胶凝剂湿润剂和 70 重量份水或有机溶剂，得到微细活性化合物悬浮液。用水稀释得到活性化合物的稳定悬浮液，从而得到 20 重量%的活性化合物配制剂。

2. 叶面施用的不经稀释而施用的产品。对于种子处理目的，该产品可以稀释或不稀释地施用于种子。

I) 可撒粉粉末(DP、DS)

将 5 重量份活性化合物精细研磨并与 95 重量份细碎高岭土充分混合。这得到含有 5 重量%活性化合物的可撒粉产品。

J) 颗粒(GR、FG、GG、MG)

将 0.5 重量份活性化合物细碎研磨并结合 95.5 重量份载体，从而得到含有 0.5 重量%活性化合物的配制剂。现行方法是挤出、喷雾干燥或流化床方

法。这得到不经稀释而用于叶面应用的颗粒。

K) ULV 溶液(UL)

将 10 重量份活性化合物溶于 90 重量份有机溶剂如二甲苯中。这得到含有 10 重量%活性化合物的产品，其不经稀释而施用于叶面。

活性成分可以直接、以其配制剂形式或由其制备的使用形式(如可直接喷雾溶液、粉末、悬浮液或分散体、乳液、油分散体、糊、粉剂、撒播用材料或颗粒形式)，借助喷雾、雾化、撒粉、撒播或浇灌来使用。使用形式完全取决于意欲的目的；在任何情况下应确保本发明活性成分的最佳可能分布。

含水使用形式可通过加入水由乳液浓缩物、糊或可湿性粉末(可喷雾粉末、油分散体)制备。为制备乳液、糊或油分散体，可借助湿润剂、增粘剂、分散剂或乳化剂将该物质直接或溶于油或溶剂中后在水中均化。或者还可以制备由活性物质、湿润剂、增粘剂、分散剂或乳化剂以及合适的话溶剂或油组成的浓缩物且该浓缩物适于用水稀释。

即用产品中的活性成分浓度可在显著宽的范围内变化。它们通常为 0.0001-10%，优选 0.01-1%。

活性成分也可成功地以超低容量法(ULV)使用，其中可以施用包含超过 95 重量%活性成分的配制剂，或甚至施用不含添加剂的活性成分。

各种类型的油、湿润剂、辅助剂、除草剂、杀真菌剂、其它农药或杀菌剂都可加入活性成分中，若合适的话，恰在紧临使用前加入(桶混合)。这些试剂通常与本发明试剂以 1:10-10:1 的重量比混合。

式 I 化合物通过接触(经由土壤、玻璃、墙壁、蚊帐(bed net)、地毯、植物部分或动物部分)和摄食(诱饵或植物部分)而有效。

用式 I 化合物及其相应组合物控制由昆虫传递的传染性疾病(例如疟疾、登革热和黄热病，淋巴丝虫病以及利什曼病)的方法也包括处理棚屋和房子的表面、空气喷雾和浸渍窗帘、帐篷、衣物、蚊帐、采采蝇捕捉器等。施用于纤维、织物、编织物、无纺织物、网状材料或箔以及篷布上的杀虫组合物优选包含包含杀虫剂、任选的驱除剂和至少一种粘合剂的混合物。合适的驱除剂例如为 N,N-二乙基-间甲苯甲酰胺(DEET)，N,N-二乙基苯基

乙酰胺(DEPA), 1-(3-环己烷-1-基羰基)-2-甲基哌啶, (2-羟基甲基环己基)乙酸内酯, 2-乙基-1,3-己二醇, 避蚊酮, 甲基新癸酰胺(MNDA), 未用于昆虫控制的拟除虫菊酯如{(±)-3-烯丙基-2-甲基-4-氧代环戊-2-(+)-烯基-(+)-反式-菊酸酯(Esbiothrin), 衍生于植物提取物或与植物提取物相同的驱除剂如 1,8-萜二烯、丁子香酚、(+)-Eucamalol(1)、(-)-1-表-eucamalol, 或来自诸如花皮桉(*Eucalyptus maculata*)、蔓荆(*Vitex rotundifolia*)、*Cymbopogon martinii*、香茅(*Cymbopogon citratus*)(柠檬草)、亚香茅(*Cymbopogon nartdus*)(香茅)的植物的粗植物提取物。合适的粘合剂例如选自如下单体的聚合物和共聚物: 脂族酸的乙烯基酯(如乙酸乙烯酯和支链烷烃脂肪酸(versatic)乙烯基酯), 醇的丙烯酸和甲基丙烯酸酯, 如丙烯酸丁酯、丙烯酸 2-乙基己基酯和丙烯酸甲酯, 单烯属和二烯属不饱和烃, 如苯乙烯, 以及脂族二烯, 如丁二烯。

窗帘和蚊帐的浸渍在大多数情况下通过将织物材料浸入杀虫剂的乳液或分散体中或将它们喷雾于所述材料上而进行。

本发明使用的组合物还可以含有其他活性成分, 例如其他农药, 杀虫剂, 除草剂, 杀真菌剂, 其他农药或杀菌剂, 肥料如硝酸铵、尿素、钾碱和过磷酸钙, 植物毒性和植物生长调节剂, 安全剂和杀线虫剂。这些额外成分可以顺序使用或与上述组合物组合使用, 合适的话也仅在紧临使用前加入(桶混合)。例如, 植物可以在用其他活性成分处理之前或之后用本发明组合物喷雾。

这些试剂可以与本发明使用的试剂以 1:10-10:1 的重量比混合。将以杀虫剂形式使用的化合物 I 或包含它们的组合物与其他杀虫剂混合通常导致更宽的杀虫作用谱。

可与式 I 化合物一起使用的下列农药用来阐述可能的组合, 而不施以任何限制:

有机(硫代)磷酸酯类: 高灭磷(Acephate)、唑啉磷(Azamethiphos)、谷硫磷(Azinphos-methyl)、毒死蜱(Chlorpyrifos)、甲基毒死蜱(Chlorpyrifos-methyl)、毒虫畏(Chlorfenvinphos)、二嗪农(Diazinon)、敌敌畏(Dichlorvos)、百治磷(Dicrotophos)、乐果(Dimethoate)、乙拌磷(Disulfoton)、乙硫磷

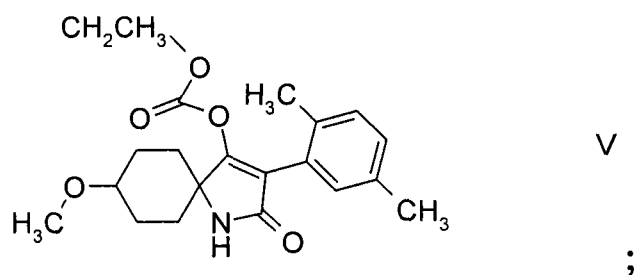
(Ethion)、杀螟松(Fenitrothion)、倍硫磷(Fenthion)、异噁唑磷(Isoxathion)、马拉硫磷(Malathion)、甲胺磷(Methamidophos)、杀扑磷(Methidathion)、甲基一六零五(Methyl-Parathion)、速灭磷(Mevinphos)、久效磷(Monocrotophos)、砒吸磷(Oxydemeton-methyl)、对氧磷(Paraoxon)、一六零五(Parathion)、稻丰散(Phenthoate)、伏杀磷(Phosalone)、亚胺硫磷(Phosmet)、磷胺(Phosphamidon)、甲拌磷(Phorate)、辛硫磷(Phoxim)、虫螨磷(Pirimiphos-methyl)、丙溴磷(Profenofos)、丙硫磷(Prothiofos)、乙丙硫磷(Sulprophos)、杀虫威(Tetrachlorvinphos)、特丁磷(Terbufos)、三唑磷(Triazophos)、敌百虫(Trichlorfon);

氨基甲酸酯类: 棉铃威(Alanycarb)、噁虫威(Bendiocarb)、丙硫克百威(Benfuracarb)、甲萘威(Carbaryl)、虫螨威(Carbofuran)、丁硫克百威(Carbosulfan)、双氧威(Fenoxycarb)、呋线威(Furathiocarb)、噁二唑虫(Indoxacarb)、灭虫威(Methiocarb)、灭多虫(Methomyl)、甲氧叉威(Oxamyl)、抗蚜威(Pirimicarb)、残杀威(Propoxur)、硫双威(Thiodicarb)、唑蚜威(Triazamate);

拟除虫菊酯类: 丙烯除虫菊(Allethrin)、氟氯菊酯(Bifenthrin)、氟氯氰菊酯(Cyfluthrin)、(RS)氟氯氰菊酯(Cyhalothrin)、苯醚氰菊酯(Cyphenothrin)、氯氰菊酯(Cypermethrin)、甲体氯氰菊酯(alpha-Cypermethrin)、乙体氯氰菊酯(beta-Cypermethrin)、己体氯氰菊酯(zeta-Cypermethrin)、溴氰菊酯(Deltamethrin)、高氰戊菊酯(Esfenvalerate)、醚菊酯(Ethofenprox)、甲氰菊酯(Fenpropathrin)、杀灭菊酯(Fenvalerate)、咪炔菊酯(Imiprothrin)、氯氟氰菊酯(Lambda-Cyhalothrin)、氯菊酯(Permethrin)、炔酮菊酯(Prallethrin)、除虫菊酯 I(Pyrethrin-I)和除虫菊酯(Pyrethrin-II)、灭虫硅醚(Silafluofen)、氟胺氰菊酯(Tau-Fluvalinate)、七氟菊酯(Tefluthrin)、胺菊酯(Tetramethrin)、四溴菊酯(Tralomethrin)、四氟菊酯(Transfluthrin);

生长调节剂: a) 几丁质合成抑制剂: 苯甲酰脲类, 如定虫隆(Chlorfluazuron)、Cyramazin、氟脲杀(Diflubenzuron)、氟螨脲

(Flucycloxuron)、氟虫脲(Flufenoxuron)、氟铃脲(Hexaflumuron)、氟丙氧脲(Lufenuron)、双苯氟脲(Novaluron)、伏虫隆(Teflubenzuron)、杀虫隆(Triflumuron); 噻嗪酮(Buprofezin)、噁茂醚(Diofenolan)、噻螨酮(Hexythiazox)、特苯噁唑(Etoxazole)、四螨嗪(Clofentazine); b) 蜕皮激素拮抗剂: 例如特丁苯酰肼(Halofenozide)、甲氧苯酰肼(Methoxyfenozide)、双苯酰肼(Tebufenozide); c) 保幼激素类似物: 例如蚊蝇醚(Pyriproxyfen)、蒙五一五(Methoprene)、双氧威(Fenoxycarb); d) 类脂生物合成抑制剂: 例如螺螨酯(Spirodiclofen)、螺甲螨酯(Spiromesifen)、式 V 的季酮酸衍生物:

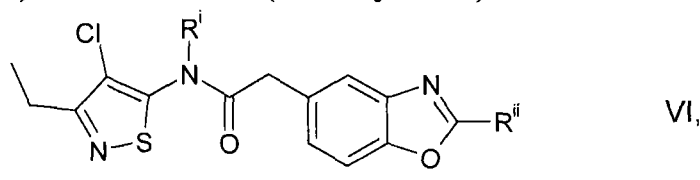


新烟碱类(neonicotinoid): 噻虫胺(Clothianidine)、呋虫胺(Dinotefuran)、吡虫啉(Imidacloprid)、噻虫嗪(Thiamethoxam)、硝胺烯啶(Nitenpyram)、硝虫噻嗪(Nithiazine)、吡虫清(Acetamiprid)、噻虫啉(Thiacloprid);

吡啶类杀虫剂, 如 Acetoprole、乙虫清(Ethiprole)、锐劲特(Fipronil)、吡螨胺(Tebufenpyrad)、啉虫酰胺(Tolfenpyrad)、氟吡啶虫(Vaniliprole);

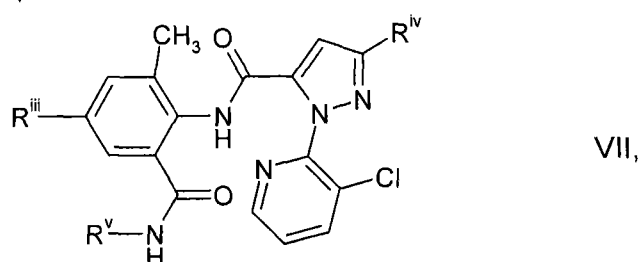
各种: 齐墩螨素(Abamectin)、灭螨醌(Acequinocyl)、Amidoflumet、虫脒(Amitraz)、艾扎丁(Azadirachtin)、Benclothiaz、联苯肼酯(Bifenazate)、双三氟虫脲(Bistrifluron)、杀螟丹(Cartap)、氟啉虫清(Chlorfenapyr)、杀虫脒(Chlordimeform)、丁氟螨酯(Cyflumetofen)、灭蝇胺(Cyromazine)、杀螨硫隆(Diafenthiuron)、四氟甲醚菊酯(Dimefluthrin)、噁茂醚(Diofenolan)、埃玛菌素(Emamectin)、硫丹(Endosulfan)、喹螨醚(Fenazaquin)、氟啉虫酰胺(Flonicamid)、Fluacyprim、氟虫酰胺(Flubendiamide)、Flufenerim、吡氟硫磷(Flupyrzofos)、伐虫脒(Formetanate)、伐虫脒盐酸盐(Formetanate hydrochloride)、灭蚁腓(Hydramethylnon)、噁二唑虫(Indoxacarb)、Lepimectin、氟氟虫胺(Metaflumizone)、米尔螨素(Milbemectin)、增效醚(Piperonylbutoxide)、

丙氟菊酯(Profluthrin)、吡螨酮(Pyridaben)、吡虫丙醚(Pyridalyl)、据嗪酮(Pymetrozine)、Pyrafluprole、Pyriprole、艾克敌 105(Spinosad)、螺虫乙酯(Spirotetramat)、硫、硫环杀(Thiocyclam)和式 VI 的氨基异噻唑化合物:



其中 Rⁱ 为氢或 -CH₂OCH₃ 且 Rⁱⁱ 为 -CF₂CF₂CF₃,

式 VII 的邻氨基苯甲酰胺化合物:



其中 Rⁱⁱⁱ 为氢或氯原子, R^{iv} 为溴原子或 CF₃ 且 R^v 为 C₁-C₆ 烷基,

以及 JP 2002/284608、WO 02/89579、WO 02/90320、WO 02/90321、WO 04/06677、WO 04/20399 或 JP 2004/099597 中所述的丙二腈化合物。

杀真菌混合配对物为选自如下的那些:

- 酰基丙氨酸类, 例如苯霜灵(benalaxyl)、甲霜灵(metalaxyl)、甲咪酰胺(ofurace)、噁霜灵(oxadixyl),
- 胺衍生物, 例如 4-十二烷基-2,6-二甲基吗啉(aldimorph)、多果定(dodine)、吗菌灵(dodemorph)、丁苯吗啉(fenpropimorph)、苯锈啉(fenpropidin)、双胍盐(guazatine)、双胍辛醋酸盐(iminoctadine)、螺噁茂胺(spiroxamine)、克啉菌(tridemorph),
- 苯胺基嘧啶类, 例如二甲嘧菌胺(pyrimethanil)、嘧菌胺(mepanipyrim)或环丙嘧啉(cyrodinyl),
- 抗菌素, 例如放线菌酮(cycloheximid)、灰黄霉素(griseofulvin)、春雷素霉(kasugamycin)、多马霉素(natamycin)、多氧霉素(polyoxin)或链霉素(streptomycin),
- 唑类, 例如双苯三唑醇(bitertanol)、糠菌唑(bromoconazole)、环唑醇(cyproconazole)、噁醚唑(difenoconazole)、烯唑醇(dinitroconazole)、氧

- 唑菌(epoxiconazole)、腈苯唑(fenbuconazole)、喹唑菌酮(fluquinconazole)、氟硅唑(flusilazole)、己唑醇(hexaconazole)、烯菌灵(imazalil)、环戊唑菌(metconazole)、腈菌唑(myclobutanil)、戊菌唑(penconazole)、丙环唑(propiconazole)、丙氯灵(prochloraz)、丙硫菌唑(prothioconazole)、戊唑醇(tebuconazole)、三唑酮(triadimefon)、唑菌醇(triadimenol)、氟菌唑(triflumizol)、戊叉唑菌(triticonazole)、粉唑醇(flutriafol),
- 二羧酰亚胺类, 如异丙定(iprodion)、甲菌利(myclozolin)、杀菌利(procymidon)、烯菌酮(vinclozolin),
 - 二硫代氨基甲酸盐类, 如福美铁(ferbam)、代森钠(nabam)、代森锰(maneb)、代森锰锌(mancozeb)、威百亩(metam)、代森联(metiram)、甲基代森锌(propineb)、福代锌(polycarbamate)、福美双(thiram)、福美锌(ziram)、代森锌(zineb),
 - 杂环化合物, 如敌菌灵(anilazine)、苯菌灵(benomyl)、啶酰菌胺(boscalid)、多菌灵(carbendazim)、萎锈灵(carboxin)、氧化萎锈灵(oxycarboxin)、氟霜唑(cyazofamid)、棉隆(dazomet)、二噻农(dithianon)、噁唑酮菌(famoxadon)、咪唑菌酮(fenamidon)、异噁菌醇(fenarimol)、麦穗宁(fuberidazole)、氟酰胺(flutolanil)、呋吡唑灵(furametpyr)、稻瘟灵(isoprothiolane)、丙氧灭锈胺(mepronil)、氟苯嘧啶醇(nuarimol)、噻菌灵(probenazole)、丙氧喹啉(proquinazid)、啶斑肱(pyrifenoxy)、咯喹酮(pyroquilon)、喹氧灵(quinoxyfen)、硅噻菌胺(silthiofam)、涕必灵(thiabendazole)、溴氟唑菌(thifluzamid)、甲基托布津(thiophanate-methyl)、噻酰菌胺(tiadinil)、三环唑(tricyclazole)、噻菌灵(triforine),
 - 铜杀真菌剂, 如波尔多液(Bordeaux混合物)、醋酸铜、王铜(copper oxychloride)、碱式硫酸铜,
 - 硝基苯基衍生物, 如乐杀螨(binapacryl)、敌螨普(dinocap)、敌螨通(dinobuton)、异丙消(nitrophthalisopropyl),
 - 苯基吡咯类, 如拌种咯(fenpiclonil)、氟噁菌(fludioxonil),
 - 硫,

- 其它杀真菌剂，如噻二唑素(acibenzolar-S-methyl)、苯噻菌胺(benthiavalicarb)、氯环丙酰胺(carpropamid)、百菌清(chlorothalonil)、环氟菌胺(cyflufenamid)、清菌脲(cymoxanil)、棉隆(dazomet)、吡菌清(diclomezin)、双氯氟菌胺(diclocymet)、乙霉威(diethofencarb)、克瘟散(edifenphos)、噻唑菌胺(ethaboxam)、环酰菌胺(fenhexamid)、薯瘟锡(fentin-acetate)、氟菌胺(fenoxanil)、嘧菌脲(ferimzone)、氟啶胺(fluzinam)、藻菌磷(fosetyl)、藻菌磷(fosetyl-aluminum)、异丙菌胺(iprovalicarb)、六氯苯(hexachlorobenzene)、苯菌酮(metrafenon)、戊菌隆(pencycuron)、百维灵(propamocarb)、四氯苯酞(phthalide)、甲基立枯磷(tolclofos-methyl)、五氯硝基苯(quintozene)、苯酰菌胺(zoxamid),
- 嗜球果伞素类(strobilurin)，如腈嘧菌酯(azoxystrobin)、醚菌胺(dimoxystrobin)、氟嘧菌酯(fluxastrobin)、亚胺菌(kresoxim-methyl)、叉氨苯酰胺(metominostrobin)、肟醚菌胺(orysastrobin)、啉氧菌酯(picoxystrobin)或肟菌酯(trifloxystrobin),
- 次磺酸衍生物，如敌菌丹(captafol)、克菌丹(captan)、抑菌灵(dichlofluanid)、灭菌丹(folpet)或对甲抑菌灵(tolyfluanid),
- 肉桂酰胺及类似化合物，如烯酰吗啉(dimethomorph)、氟联苯菌(flumetover)或氟吗啉(flumorph)。

可以使动物害虫，即昆虫、蜘蛛和线虫，植物生长于其中的植物、土壤或水体与本发明化合物 I 或含有它们的组合物通过任何本领域已知的施用方法接触。这里的“接触”包括直接接触(将化合物/组合物直接施用于动物害虫或植物上，通常施用于植物的叶、茎或根上)和间接接触(将化合物/组合物施用于动物害虫或植物所在场所)。

此外，动物害虫可以通过使目标害虫、其食物供应源、栖息地、繁殖地或其场所与杀虫有效量的式 I 化合物接触而控制。这里的施用可以在场所、生长作物或收获的作物被害虫侵染之前或之后进行。

“场所”是指害虫或寄生虫生长或可能生长于其中的栖息地、繁殖地、植物、种子、土壤、区域、材料或环境。

通常而言，“杀虫有效量”指对生长获得可观察到的效果所需的活性

成分的量,所述效果包括坏死、死亡、延缓、预防和除去效果,破坏效果或目标生物体的出现和活动降低效果。对于用于本发明的各种化合物/组合物,杀虫有效量可以变化。组合物的杀虫有效量也可以根据盛行的条件如所需杀虫效果和持续时间、气候、目标种类、场所、施用方式等而改变。

式 I 化合物及其组合物可以用于保护木质材料,例如树、板垣、枕木等以及建筑物如房屋、附属建筑、工厂,还有建筑材料、家具、皮革、纤维、乙烯制品、电线和电缆等以防蚂蚁和/或白蚁,以及用于防止蚂蚁和白蚁危害作物或人类(例如当害虫侵入房屋和公共设施时)。式 I 化合物不仅施用于周围土壤表面或地下土壤以保护木质材料,而且还可以施用于木料制品如地下混凝土、邮亭、横梁、胶合板、家具等的表面,木质制品如碎料板、半成品板(half board)等以及乙烯制品如涂敷电线、乙烯板,绝热材料如苯乙烯泡沫等。在防止蚂蚁危害作物或人类的应用情况下,将本发明的蚂蚁控制剂施用于作物或周围土壤,或直接施用于蚁穴等。

本发明化合物还可以预防性地施用于预期出现害虫的地方。

式 I 化合物还可以用于保护生长植物以防害虫侵袭或侵染,其中使植物与杀虫有效量的式 I 化合物接触。这里的“接触”包括直接接触(将化合物/组合物直接施用于害虫和/或植物上,通常施用于植物的叶、茎或根上)和间接接触(将化合物/组合物施用于害虫和/或植物的场所)。

在土壤处理或施用于害虫居住地或巢穴的情况下,活性成分的量可为 0.0001-500g/100m²,优选 0.001-20g/100m²。

在材料保护中的常用施用率例如为 0.01-1000g 活性化合物/m² 被处理材料,理想的是 0.1-50g/m²。

用于材料浸渍中的杀虫组合物通常含有 0.001-95 重量%,优选 0.1-45 重量%,更优选 1-25 重量%至少一种驱除剂和/或杀虫剂。

对于诱饵组合物中的应用,活性成分的典型含量为 0.001-15 重量%,理想的是 0.001-5 重量%活性化合物。

对于喷雾组合物中的应用,活性成分的含量为 0.001-80 重量%,优选 0.01-50 重量%,最优选 0.01-15 重量%。

对于处理作物植物中的应用,本发明活性成分的施用率可以为

0.1-4000g/公顷，理想的是 25-600g/公顷，更理想的是 50-500g/公顷。

在种子处理中，该混合物的施用率通常为 0.1g-10kg/100kg 种子，优选 1g-5kg/100kg 种子，尤其是 1-200g/100kg 种子。

式 I 化合物还适合处理种子以保护种子以防昆虫害虫，尤其是土壤生存昆虫害虫并保护所得植物的根和芽以防土壤害虫和叶部昆虫。

式 I 化合物特别用于保护种子以防土壤害虫并保护所得植物的根和芽以防土壤害虫和叶部昆虫。优选所得植物的根和芽的保护。更优选保护所得植物的芽以防刺吸式昆虫，其中最优选防止蚜虫。

本发明因此包括一种保护种子以防昆虫，尤其是土壤昆虫以及保护秧苗的根和芽以防昆虫，尤其是土壤和叶部昆虫的方法，该方法包括使种子在播种之前和/或在催芽之后与通式 I 的化合物或其盐接触。特别优选其中保护植物的根和芽的方法，更优选其中保护植物芽以防刺吸式昆虫的方法，最优选其中保护植物芽以防蚜虫的方法。

术语种子包括所有种类的种子和植物繁殖体，包括但不限于真正的种子、种子切片(seed piece)、吸枝、球茎、鳞茎、果实、块茎、谷粒、插条、伐条(cut shoot)等，并且在优选实施方案中指真正的种子。

尤其可以用于种子处理的组合物例如为：

A 水溶性浓缩物(SL、LS)

D 乳液(EW、EO、ES)

E 悬浮液(SC、OD、FS)

F 水分散性颗粒和水溶性颗粒(WG、SG)

G 水分散性粉末和水溶性粉末(WP、SP、SS、WS)

H 凝胶配制剂(GF)

I 可撒粉粉末(DP、DS)

式 I 化合物还适于处理种子。常规种子处理剂例如包括流动剂 FS、溶液 LS、干拌种粉末 DS、湿拌种用水分散性粉末 WS、水溶性粉末 SS 和乳液 ES。对种子的施用在播种之前进行，直接施用于种子上或在已对种子催芽之后施用。

用于种子处理的式 I 化合物的优选 FS 配制剂通常包含 0.1-80 重量

%(1-800g/L)活性成分, 0.1-20 重量%(1-200g/L)至少一种表面活性剂, 例如 0.05-5 重量%润湿剂和 0.5-15 重量%分散剂, 至多 20 重量%, 例如 5-20% 防冻剂, 0-15 重量%, 例如 1-15 重量%颜料和/或染料, 0-40 重量%, 例如 1-40 重量%粘合剂(粘着剂/粘附剂), 任选至多 5 重量%, 例如 0.1-5 重量%增稠剂, 任选 0.1-2%消泡剂, 以及例如用量为 0.01-1 重量%的任选防腐剂如生物杀伤剂、抗氧化剂等, 和至多 100 重量%的填料/赋形剂。

对种子处理配制剂合适的颜料或染料为颜料蓝 15:4, 颜料蓝 15:3, 颜料蓝 15:2, 颜料蓝 15:1, 颜料蓝 80, 颜料黄 1, 颜料黄 13, 颜料红 112, 颜料红 48:2, 颜料红 48:1, 颜料红 57:1, 颜料红 53:1, 颜料橙 43, 颜料橙 34, 颜料橙 5, 颜料绿 36, 颜料绿 7, 颜料白 6, 颜料棕 25, 碱性紫 10, 碱性紫 49, 酸性红 51, 酸性红 52, 酸性红 14, 酸性蓝 9, 酸性黄 23, 碱性红 10, 碱性红 108。

加入也称为粘着剂/粘附剂的粘合剂以改善处理之后活性物质对种子的粘附。合适的粘合剂为 EO/PO 嵌段共聚物表面活性剂, 还有聚乙烯醇、聚乙烯基吡咯烷酮、聚丙烯酸酯、聚甲基丙烯酸酯、聚丁烯、聚异丁烯、聚苯乙烯、聚乙烯胺、聚乙烯酰胺、聚乙烯亚胺(Lupasol[®]、Polymin[®])、聚醚和衍生于这些聚合物的共聚物。

本发明因此还涉及包含本文所定义的式 I 化合物或 I 的可农用盐的种子。化合物 I 或其可农用盐的量通常在 0.1g-10kg/100kg 种子, 优选 1g-5kg/100kg 种子, 尤其是 1-1000g/100kg 种子的范围内变化。

还可以施用本发明化合物以防非作物昆虫害虫, 如蚂蚁、白蚁、黄蜂、蝇、蚊子、蟋蟀或蟑螂。为了用于所述非作物害虫, 优选将式 I 化合物用于诱饵组合物中。

诱饵可以是液体、固体或半固体制剂(例如凝胶)。可以固体诱饵成形为各种适合相应用途的形状和形式, 如颗粒、块、棒、片。液体诱饵可以填充到各种装置中以确保适当施用, 例如敞开容器、喷雾装置、液滴源或蒸发源。凝胶可以基于含水或油状基质且可以按照粘性、水分保留或老化特性的特殊要求配制。

用于组合物中的诱饵是具有足够的吸引力以刺激诸如蚂蚁、白蚁、黄

蜂、蝇、蚊子、蟋蟀等的昆虫或蟑螂去吃的产品。该吸引可以通过使用进食刺激剂或性信息素调节。进食刺激剂例如选自但不仅仅选自动物和/或植物蛋白(肉、鱼或血液膳食,昆虫部分,蛋黄)、动物和/或植物来源的脂肪和油或单有机糖、低聚有机糖或聚有机糖,尤其是选自蔗糖、乳糖、果糖、右旋糖、葡糖糖、淀粉、果胶或甚至糖蜜或蜂蜜。水果、作物、植物、动物、昆虫或其特定部分的新鲜或腐败部分也可以用作进食刺激剂。已知性信息素更具昆虫特异性。特异性信息素描述于文献中且对本领域熟练技术人员是已知的。

为了用于诱饵组合物中,活性成分的典型含量为 0.001-15 重量%,理想的是 0.001-5 重量%活性化合物。

式 I 化合物的配制剂如气雾剂(例如在喷雾罐中)、油喷雾剂或泵喷雾剂高度适于非专业使用者来控制害虫如蝇、跳蚤、蝉、蚊子或蟑螂。气雾剂配方优选由如下组分组成:活性化合物;溶剂如低级醇(例如甲醇、乙醇、丙醇、丁醇),酮类(例如丙酮、甲基乙基酮),沸点范围为约 50-250°C 的链烷烃(例如煤油),二甲基甲酰胺, N-甲基吡咯烷酮,二甲亚砜,芳族烃类如甲苯、二甲苯,水;此外还有助剂,例如乳化剂如山梨糖醇单油酸酯、具有 3-7mol 氧化乙烯的油基乙氧基化物、脂肪醇乙氧基化物,香料油如精油,中等脂肪酸与低级醇的酯,芳族羰基化合物;合适的话还有稳定剂如苯甲酸钠,两性表面活性剂,低级环氧化物,原甲酸三乙酯和需要的话推进剂如丙烷、丁烷、氮气、压缩空气、二甲醚、二氧化碳、氧化亚氮或这些气体的混合物。

油喷雾配制剂与气雾剂配方的不同在于没有使用推进剂。

为了用于喷雾组合物中,活性成分的含量为 0.001-80 重量%,优选 0.01-50 重量%,最优选 0.01-15 重量%。

式 I 化合物及其相应的组合物还可以用于蚊香片和熏蒸片,发烟盒、蒸发器板或长效蒸发器以及防蛀纸、防蛀垫或其他与热无关的蒸发器体系中。

现在由下列实施例更详细说明本发明。

1. 制备实施例:

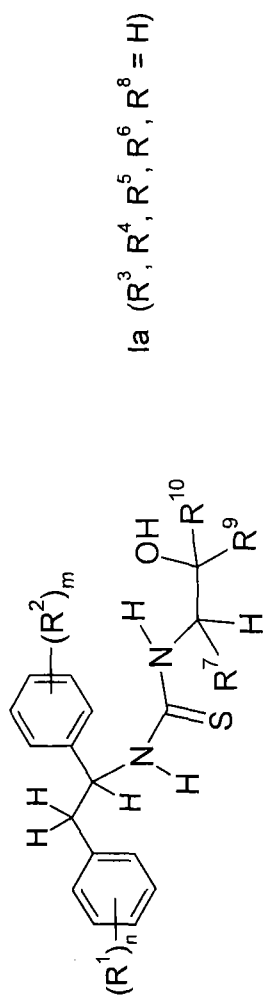
1-[1-(4-氯苯基)-2-苯基乙基]-3-(2-羟基乙基)硫脲(实施例 29)

将 1-(4-氯苯基)-2-苯基乙基胺(4.86g)加入在二氯甲烷(40ml)中的硫光气(2.88g)、碳酸钾(8.56g)和水(10ml)的混合物中。将该混合物搅拌整夜。然后将反应混合物倾入水中并用二氯甲烷萃取水相,得到 5.67g(99%) 1-氯-4-(1-异硫氰酸根合-1-苯基乙-2-基)苯。

用乙醇胺(0.11g)处理 1-氯-4-(1-异硫氰酸根合-1-苯基乙-2-基)苯(0.50g)在氯仿(30ml)中的溶液并在室温下搅拌整夜。在二氧化硅上的层析得到所需产物(0.30g)。

可以相应地制备通式 Ia 化合物。这些化合物的光谱数据列于表 1 中。

表 1



实施例	$(R^1)_n$	$(R^2)_m$	R^7	R^9	R^{10}	物理化学数据 (熔点 [°C]; 1H -NMR(d^6 -DMSO): δ [ppm])
1	-	-	H	H	H	142-46
2	4-CH ₃	-	H	H	H	159-162
3	-	-	CH(CH ₃) ₂	H	H	104-110
4	-	-	CH ₂ -C ₂ H ₅	H	H	106-109
5	-	-	CH ₂ CH ₂ C ₂ H ₅	H	H	85-88
6	-	-	CH ₃	CH ₃	CH ₃	60-61
7	4-CH ₃	-	C ₂ H ₅	H	H	130-135
8	4-CH ₃	-	CH(CH ₃) ₂	H	H	130-136
9	4-CH ₃	-	Bn	H	H	124-130
10	3-Cl	-	H	H	H	2.8-3.15(m), 3.25-3.5(m), 4.8(br s), 5.6(br s), 7.1-7.5(m), 8.0(br s)
11	2-F	-	H	H	苯基	141-143
12	3,5-(CH ₃) ₂	2,5-二 Cl	H	H	H	161-163
13	3-F	-	H	苯基	H	142-144
14	2-Cl	4-F	H	H	H	126-128
15	3,4-二 F	-	H	H	H	143-147

实施 例	(R ¹) _n	(R ²) _m	R ⁷	R ⁹	R ¹⁰	物理化学数据(熔点 [°C]; ¹ H-NMR(d ⁶ -DMSO): δ [ppm])
16	3-Cl, 4-F	-	H	H	H	2.95-3.1(m), 3.3-3.5(m), 4.8(br s), 5.6(br s), 7.1-7.45(m), 8.0(br s)
17	3-CF ₃	-	H	H	H	CDCl ₃ : 3.15(mc), 3.3(mc), 3.55(mc), 3.65(mc), 5.2(br s), 6.05(br s), 7.15-7.5(m)
18	3-Cl, 5-Cl	-	H	H	H	3.0-3.1(m), 3.3-3.5(m), 4.8(br s), 5.6(br s), 7.2-7.5(m), 8.0(br s).
19	2,3,4,5,6-五 F	-	H	H	H	133-135
20	-	2,6-二 Cl	H	H	H	133-134
21	3-CH ₃	2,6-二 Cl	H	H	H	146-149
22	3-CH ₃	2,3-二 Cl	H	H	H	162
23	-	2,3-二 Cl	H	H	H	149-151
24	-	3,4-二 OCH ₃	H	H	H	107-109
25	-	2-OC ₂ H ₅	H	H	H	132-133
26	-	2-C ₂ H ₅	H	H	H	116-118
27	3-CH ₃	4-C ₂ H ₅	H	H	H	109-111
28	-	2-Cl	H	H	H	152-155
29	4-Cl	-	H	H	H	CDCl ₃ : 2.7(br s), 2.95-3.2(m), 3.3-3.6(m), 5.3(br s), 6.45(br s), 7.0-7.3(m)
30	3-CH ₃	2-Cl	H	H	H	151-153
31	-	2-OCH ₃	H	H	H	136-139
32	3-CH ₃	4-Cl	H	H	H	141-142

实施 例	(R ¹) _n	(R ²) _m	R ⁷	R ⁹	R ¹⁰	物理化学数据 (熔点 [°C] ; ¹ H-NMR(d ⁶ -DMSO): δ [ppm])
33	-	4-OCH ₃	H	H	H	84-86
34	3-CH ₃	3-Cl	H	H	H	89-92
35	-	2-F	H	H	H	156-157
36	-	3-F	H	H	H	134-135
37	-	4-F	H	H	H	96-98
38	3-CH ₃	2-CH ₃	H	H	H	128-130
39	3-CH ₃	2-F	H	H	H	115-117
40	3-CH ₃	3-F	H	H	H	93-94
41	3-CH ₃	3-CH ₃	H	H	H	111-112
42	-	2-Br	H	H	H	157-160
43	-	3-Br	H	H	H	112-115
44	3-CH ₃	2-OCH ₃	H	H	H	121-122
45	3-CH ₃	4-OCH ₃	H	H	H	114-128
46	-	2-SCH ₃ , 5-Br, 6-CH ₃	H	H	H	119-122
47	-	2-S-(4-Cl-苯基)	H	H	H	132-134
48	-	2-CF ₃ , 3-苯基	H	H	H	144-147
49	-	2,3-F	H	H	H	120-124
50	-	2-CH ₃ , 3-F	H	H	H	132-135
51	-	2-F, 3-CF ₃	H	H	H	126-128
52	-	2,3-二-CH ₃	H	H	H	141-144
53	3-CH ₃	2,3-二-F	H	H	H	119-122
54	3-CH ₃	2,3-二-CH ₃	H	H	H	136-138
55	3-CH ₃	2-Br	H	H	H	161-164
56	3-CH ₃	4-Br	H	H	H	151-152

实例	(R ¹) _n	(R ²) _m	R ⁷	R ⁹	R ¹⁰	物理化学数据 (熔点 [°C]; ¹ H-NMR(d ⁶ -DMSO): δ [ppm])
57	3,4-O-CH ₂ -O-	-	H	H	H	143-146
58	3,4-CH ₃	2,3-二 Cl	H	H	H	175-177
59	3,4-CH ₃	-	H	H	H	100-102
60	-	2,5-二 Cl	H	H	H	155-157
61	-	2,4-二 Br	H	H	H	
62	3-CH ₃	2,3-二 Cl, 4-CH ₃	H	H	H	191-193
63	4-苯基	-	H	H	H	193-194
64	4-CH ₃	2,3-二 Cl	H	H	H	181-182
65	3-CH ₃	3,4-二 Cl	H	H	H	142-144
66	4-OCH ₃	2,3-二 Cl	H	H	H	160-162
67	3-CH ₃	2-Br, 4-F	H	H	H	121-124
68	-	2,6-二 F	H	H	H	133-135
69	3-CH ₃	4-CF ₃	H	H	H	151-152
70	4-C(CH ₃) ₂	2,3-二 Cl	H	H	H	185-187
71	2-CH ₃	2,3-二 CH ₃	H	H	H	128-131
72	3,5-二 CH ₃	2,3-二 Cl	H	H	H	185-187
73	3-CH ₃	3,5-二 CH ₃	H	H	H	98-100
74	4-OBn	2,3-二 Cl	H	H	H	117-118
75	4-OCH ₃ , 3-CH ₃	2,3-二 Cl	H	H	H	159-166
76	2,5-二 Cl	2,3-二 CH ₃	H	H	H	143-146
77	3-CF ₃	2,5-二 Cl	H	H	H	152-154
78	3-CH ₃ ,4-F	2,3-二 Cl	H	H	H	135-137

实例	(R ¹) _n	(R ²) _m	R ⁷	R ⁹	R ¹⁰	物理化学数据 (熔点 [°C]; ¹ H-NMR(d ⁶ -DMSO): δ [ppm])
79	3,5-二CF ₃	2,3-二Cl	H	H	H	3.2-3.6(m), 3.8(mc), 5.95(s), 6.4(s), 7.0-7.8(m)
80	3-CH ₃	2-F, 5-CH ₃	H	H	H	108-109
81	3,5-二CH ₃	2-CH ₃ , 5-F	H	H	H	131-134
82	3-CH ₃	2,5-二F	H	H	H	124-125
83	3,5-二CH ₃	2,3-二CH ₃	H	H	H	2.15(m), 2.75-2.90(m), 3.3-3.5(m), 4.8(s), 5.85(s), 6.8(s), 7.0.7.45(m), 7.95(d)
84	3,5-二CH ₃	2-Cl, 5-CF ₃	H	H	H	2.15(s), 2.85-3.00(m), 3.3-3.5(m), 4.85-5.95(s), 6.95-7.2(m), 7.55-7.75(m), 8.15(d)
85	3,5-二CH ₃	2-F, 5-CH ₃	H	H	H	108-109

2. 对害虫的作用实施例

通过下列试验证实化合物 I 对害虫的作用:

按如下配制活性化合物:

- a. 为了测试对棉蚜(*Aphis gossypii*)、桃蚜(*Myzus persicae*)和蚕豆蚜(*Aphis fabae*)的活性, 配制成 50:50 丙酮:水溶液并用 100ppm Kinetic[®](表面活性剂)修正,
- b. 为了测试对南部灰翅夜蛾(*Spodoptera eridania*)的活性, 配制成在 35% 丙酮和水的混合物中的 10.000ppm 溶液, 需要的话用水稀释。

在试验完成之后, 在每种情况下测定与未处理对照相比化合物仍引起 75-100%抑制率或死亡率的最低浓度(极限浓度或最小浓度)。

2.1 棉蚜(*Aphis gossypii*)

通过将侵染的叶片置于试验植物的顶部而将子叶阶段的棉花植物(栽培品种 'Delta Pine') 用约 100 只实验室饲养的蚜虫侵染。24 小时后移走所述叶片。将整个植物的子叶浸入试验化合物的梯度溶液中。5 天后相对于对照植物测定被处理植物上的蚜虫死亡率。

在该试验中, 与未处理对照相比, 实施例 10、17、18、22、23、34、39、40、41、53、54、55、58、59、64、66、72、73、77、78、79、81、82、83 和 85 的化合物在 300ppm 下显示出超过 80%的死亡率。

2.2 桃蚜(*Myzus persicae*)

通过将侵染的叶片置于试验植物的顶部而将第 2 对叶阶段的辣椒植物(栽培品种为 'California Wonder') 用约 40 只实验室饲养的蚜虫侵染。24 小时后移走所述叶片。将整个植物的叶子浸入试验化合物的梯度溶液中。5 天后相对于对照植物上的死亡率测定被处理植物上的蚜虫死亡率。

在该试验中, 与未处理对照相比, 实施例 1、2、10、14、15、16、17、18、22、23、34、36、38、39、40、41、44、49、50、52、53、54、55、57、58、59、60、61、64、66、72、73、76、77、78、79、80、81、82、83 和 85 的化合物在 300ppm 下显示出超过 80%的死亡率。

2.3 蚕豆蚜(*Aphis fabae*)

通过将侵染的切割植物置于试验植物的顶部而将第一对叶阶段的旱金

莲属植物(栽培品种为 ‘Mixed Jewel’)用约 25 只实验室饲养的蚜虫侵染。24 小时后移走所述切割植物。将试验植物的叶和茎浸入试验化合物的梯度溶液中。3 天后测定蚜虫死亡率。

在该试验中,与未处理对照相比,实施例 79、80、81、82 的化合物在 300ppm 显示出超过 90%的死亡率。

2.4 亚热带粘虫(南部灰翅夜蛾(*Spodoptera eridania*)), 2龄幼虫

将包含在单个 3.8cm² 塑料盆中的处于生长的第一真叶阶段的两株利马豆(*Sieva lima bean*)的叶子浸入试验溶液中并搅动 3 秒钟,然后在通风橱中干燥。然后将盆置于 25.4cm 顶部拉封(zipper top)塑料袋中并用 10 只 2 龄幼虫侵染。在第 5 天观察死亡率、进食减退或对正常蜕皮的任何干扰。

在该试验中,与未处理对照相比,实施例 77 的化合物在 300ppm 下显示出超过 75%的死亡率。