

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

C07C311/13

A01N 41/06

A61K 31/277



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 03814364. X

[43] 公开日 2005 年 8 月 31 日

[11] 公开号 CN 1662489A

[22] 申请日 2003.6.18 [21] 申请号 03814364. X

[30] 优先权

[32] 2002. 6. 19 [33] GB [31] 0214117. 4

[86] 国际申请 PCT/EP2003/006483 2003. 6. 18

[87] 国际公布 WO2004/000798 英 2003. 12. 31

[85] 进入国家阶段日期 2004. 12. 20

[71] 申请人 诺瓦提斯公司

地址 瑞士巴塞尔

[72] 发明人 A·西埃格 W·赞巴赫

J·鲍威尔 P·迪克雷

[74] 专利代理机构 北京市中咨律师事务所

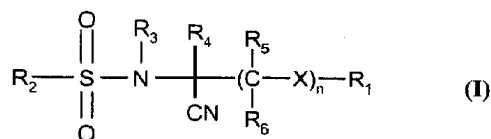
代理人 黄革生 林柏楠

权利要求书 5 页 说明书 45 页 按照条约第 19 条的修改 5 页

[54] 发明名称 具有杀虫性质的 N-磺酰氨基乙腈

[57] 摘要

本发明涉及通式(I)的化合物、并且如果适当的话还涉及其对映异构体, 该活性化合物具有有利的杀虫性质。它们特别适合用于防治温血动物中的寄生虫。



ISSN 1008-4274

则它们在每种情况下可以相同或不同；

R_8 为未取代或单至五取代的芳基，其中取代基选自卤素、硝基、氰基、 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基和卤代- C_1 - C_6 烷氧基，并且如果取代基的数目大于1，则它们可以相同或不同；

X为O、S、S(O)或S(O)₂；以及

n为0或1。

2. 根据权利要求1的式(I)化合物，其中 R_1 为未取代的或者被 R_7 单至五取代的芳基，其中如果取代基的数目大于1，则它们在每种情况下可以相同或不同。

3. 根据权利要求1的式(I)化合物，其中 R_1 为被 R_7 单至三取代的芳基，其中如果取代基的数目大于1，则它们在每种情况下可以相同或不同。

4. 根据权利要求1的式(I)化合物，其中 R_2 为 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、在每种情况下为未取代或被 R_7 单至多取代的芳基或杂芳基，其中如果取代基的数目大于1，则它们在每种情况下可以相同或不同。

5. 根据权利要求1的式(I)化合物，其中 R_2 为 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基或未取代或被 R_7 单至五取代的芳基，其中如果取代基的数目大于1，则它们可以相同或不同。

6. 根据权利要求1的式(I)化合物，其中 R_2 为未取代或被 R_7 单至三取代的芳基，其中如果取代基的数目大于1，则它们可以相同或不同。

7. 根据权利要求1的式(I)化合物，其中 R_3 为氢或 C_1 - C_6 烷基。

8. 根据权利要求1的式(I)化合物，其中 R_3 为氢或 C_1 - C_4 烷基。

9. 根据权利要求1的式(I)化合物，其中 R_3 为氢。

10. 根据权利要求1的式(I)化合物，其中 R_4 、 R_5 和 R_6 彼此独立地为氢、 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、卤代- C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_3 - C_6 环烷基。

11. 根据权利要求1的式(I)化合物，其中 R_4 、 R_5 和 R_6 彼此独立地为氢、 C_1 - C_4 烷基、卤代- C_1 - C_4 烷基或 C_3 - C_6 环烷基。

12. 根据权利要求1的式(I)化合物，其中 R_4 、 R_5 和 R_6 彼此独立地为氢或

C₁-C₂烷基。

13. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中R₇为卤素、C₁-C₄烷基、卤代-C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基、卤代-C₁-C₄烷氧基; 在每种情况下为未取代或单或多取代的芳基或苯基乙炔基, 其中取代基选自卤素、C₁-C₆烷基、卤代-C₁-C₆烷基、C₁-C₆烷氧基、卤代-C₁-C₆烷氧基, 且如果取代基的数目大于1, 则它们在每种情况下可以相同或不同。

14. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中R₇为卤素、C₁-C₂烷基、卤代-C₁-C₂烷基、C₁-C₂烷氧基、卤代-C₁-C₂烷氧基。

15. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中R₇为卤素或卤代-C₁-C₂烷基。

16. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中R₈为未取代或单至三取代的芳基, 其中取代基选自卤素、C₁-C₄烷基、卤代-C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基和卤代-C₁-C₄烷氧基, 且如果取代基的数目大于1, 则它们可以相同或不同。

17. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中R₈为单至三取代的芳基, 其中取代基选自卤素、C₁-C₂烷基、卤代-C₁-C₂烷基和卤代-C₁-C₂烷氧基, 且如果取代基的数目大于1, 则它们可以相同或不同。

18. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中R₈为单或二取代的芳基, 其中取代基选自卤素和卤代-C₁-C₂烷基, 且如果取代基的数目大于1, 则它们可以相同或不同。

19. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中X为O或S。

20. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中X为O。

21. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中n为1。

22. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中R₁为未取代被R₇单或五取代的芳基, 其中如果取代基的数目大于1, 则它们在每种情况下可以相同或不同; R₂为C₁-C₆烷基、卤代-C₁-C₆烷基、在每种情况下是未取代或被R₇单或多取代的芳基或杂芳基, 其中如果取代基的数目大于1, 则它们在每种情况下可以相同或不同; R₃为氢或C₁-C₆烷基; R₄、R₅和R₆彼此独立地为氢、C₁-C₆烷基、卤代-C₁-C₆烷基、C₁-C₆烷氧基、卤代-C₁-C₆烷氧基、C₂-C₆链烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₆环烷基; R₇为卤素、C₁-C₄烷基、卤代-C₁-C₄烷基、C₁-C₄

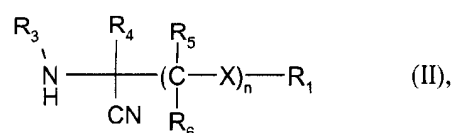
烷氧基、卤代-C₁-C₄烷氧基、在每种情况下为未取代或单或多取代的芳基或苯基乙炔基，其中取代基选自卤素、C₁-C₆烷基、卤代-C₁-C₆烷基、C₁-C₆烷氧基、卤代-C₁-C₆烷氧基，且如果取代基的数目大于1，则它们在每种情况下可以相同或不同；R₈为未取代或单至三取代的芳基，其中取代基选自卤素、C₁-C₄烷基、卤代-C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基和卤代-C₁-C₄烷氧基，且如果取代基的数目大于1，则它们可以相同或不同；X为O或S且n为1。

23. 根据权利要求1的式(I)化合物，其中R₁为被R₇单或三取代的芳基，其中如果取代基的数目大于1，则它们在每种情况下可以相同或不同；R₂为C₁-C₆烷基、卤代-C₁-C₆烷基或未取代或被R₇单至五取代的芳基，其中如果取代基的数目大于1，则它们可以相同或不同；R₃为氢或C₁-C₄烷基；R₄、R₅和R₆彼此独立地为氢、C₁-C₄烷基、卤代-C₁-C₄烷基或C₃-C₆环烷基；R₇为卤素、C₁-C₂烷基、卤代-C₁-C₂烷基、C₁-C₂烷氧基或卤代-C₁-C₂烷氧基；R₈为单至三取代的芳基，其中取代基选自卤素、C₁-C₂烷基、卤代-C₁-C₂烷基和卤代-C₁-C₂烷氧基，且如果取代基的数目大于1，则它们可以相同或不同；X为O且n为1。

24. 根据权利要求1的式(I)化合物，其中R₁为被R₇单至三取代的芳基，其中如果取代基的数目大于1，则它们在每种情况下可以相同或不同；R₂为未取代或被R₇单至三取代的芳基，其中如果取代基的数目大于1，则它们在每种情况下可以相同或不同；R₃为氢；R₄、R₅和R₆彼此独立地为氢或C₁-C₂烷基；R₇为卤素或卤代-C₁-C₂烷基；R₈为单或二取代的芳基，其中取代基选自卤素和卤代-C₁-C₂烷基，且如果取代基的数目大于1，则它们可以相同或不同；X为O且n为1。

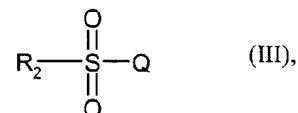
25. 根据权利要求1的式(I)化合物，命名为N-(1-氨基-1-[2,3-二氯苯氧甲基]乙基)-C-苯基甲磺酰胺。

26. 制备根据权利要求1的在每种情况下为游离形式或盐形式的式(I)化合物的方法，其特征在于使已知或可类似于相应已知化合物制备的式(II)化合物



其中 R_1 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 X 和 n 如式(I)中定义,

与已知或可根据类似于已知化合物制备的式(III)化合物反应,



其中 R_2 如式(I)中定义且 Q 为离去基团, 如果合适的话在碱性催化剂存在下反应, 并且在每种情况下如果需要, 将根据该方法或另一种方法可得到的、在每种情况下为游离形式或盐形式的式(I)化合物转化为另一种式(I)化合物, 将根据该方法可得到的异构体混合物分离并分离出需要的异构体和/或将根据该方法可得到的游离式(I)化合物转化为盐, 或者将根据该方法可得到的式(I)化合物的盐转化为游离式(I)化合物或另一种盐。

27. 用于防治寄生虫的组合物, 其除了载体和/或分散剂外, 还含有至少一种根据权利要求1的式(I)化合物作为活性化合物。

28. 根据权利要求1的式(I)化合物用于防治寄生虫的用途。

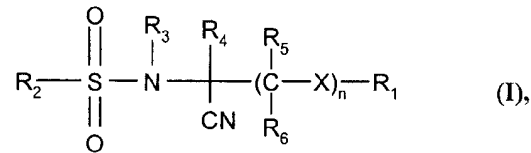
29. 防治寄生虫的方法, 其特征在于使用有效量的至少一种根据权利要求1的式(I)化合物对抗寄生虫。

30. 根据权利要求1的式(I)化合物在防治温血动物中寄生虫的方法中的用途。

31. 根据权利要求1的式(I)化合物在制备对抗温血动物中寄生虫的药物组合物中的用途。

具有杀虫性质的N-磺酰氨基乙腈

本发明涉及式(I)的新的磺酰氨基乙腈化合物、以及如果恰当的话还涉及其E/Z异构体、E/Z异构体混合物和/或互变异构体,在每种情况下为游离形式或盐形式:



其中:

R_1 为芳基或杂芳基,其在每种情况下是未取代的或者被 R_7 单取代或多取代,其中如果取代基的数目大于1,则它们在每种情况下可以相同或不同;

R_2 为 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_8 环烷基、卤代- C_3 - C_8 环烷基、 NHR_8 ;芳基或杂芳基,其在每种情况下是未取代的或者被 R_7 单取代或多取代,其中如果取代基的数目大于1,则它们在每种情况下可以相同或不同,或者为吡咯烷基、吡啶基、咪唑烷基、哌嗪基、吡唑烷基、吗啉基、二氢吲哚基或异二氢吲哚基,在每种情况下通过N键合;

R_3 为氢、 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基- C_1 - C_6 烷基、苄基、 C_1 - C_6 烷基-杂芳基、 C_1 - C_6 烷氧羰基或 C_1 - C_6 烷基羰基;

R_4 、 R_5 和 R_6 彼此独立地为氢、卤素、 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、卤代- C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、卤代- C_1 - C_6 烷硫基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 炔基、未取代或被选自卤素和 C_1 - C_6 烷基的取代基取代的 C_3 - C_8 环烷基、或者未取代或被选自卤素、 C_1 - C_6 烷基和苯基的取代基取代的苯基;

或者 R_4 和 R_5 与它们键合的碳原子一起为具有1或2个选自氮、氧和硫的杂原子的五元至七元的饱和或部分不饱和杂环;

R_7 为卤素、 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、卤代- C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、卤代- C_1 - C_6 烷硫基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 炔基;芳基、苯基乙炔基或杂芳基,其在每种情况下是未取代的或者单或多取代的,

其中取代基在每种情况下选自卤素、硝基、氰基、 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、卤代- C_1 - C_6 烷氧基，并且如果取代基的数目大于1，则它们在每种情况下可以相同或不同；

R_8 为未取代或单至五取代的芳基，其中取代基选自卤素、硝基、氰基、 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基和卤代- C_1 - C_6 烷氧基，并且如果取代基的数目大于1，则它们可以相同或不同；

X为O、S、S(O)或S(O)₂；以及

n为0或1；

还涉及这些化合物、其异构体和互变异构体的制备方法及其用途；用于制备式(I)化合物的起始化合物；其活性化合物选自式(I)化合物及其互变异构体的杀虫剂；以及使用这些组合物来控制对植物有害的昆虫和蜱螨(Acarina)目中的代表、以及在温血农业和家养动物体内和体外的体内和体外寄生虫、特别是蠕虫的方法。

具有杀虫作用的取代的氨基乙腈化合物在文献中已有描述。然而文献中实际公开的活性化合物在作用效力和作用谱方面并不是总能达到要求。因此需要有一种杀虫性质改善了的活性化合物。目前已经发现，本发明的式(I)化合物具有突出的杀虫性质、特别是在农业和家养动植物体内和体外对抗体内和体外寄生虫时具有突出的杀虫特性。

某些式(I)化合物可以是互变异构体的形式。因此在上下文中，式(I)化合物适当时可理解为包括相应的互变异构体，即使后者在每种情形下没有明确提及。

式(I)化合物、且适当时及其互变异构体可形成盐，例如酸加成盐。这些酸加成盐可例如通过无机强酸形成，所述无机强酸例如是矿酸，如硫酸、磷酸或氢卤酸；或者通过强有机羧酸形成，所述有机羧酸例如是未取代的或取代的、例如卤代的 C_1 - C_4 烷基羧酸如乙酸、饱和或不饱和二羧酸如草酸、丙二酸、马来酸、富马酸和邻苯二甲酸、羟基羧酸如抗坏血酸、乳酸、苹果酸、酒石酸和柠檬酸或苯甲酸；或者通过有机磺酸形成，所述有机磺酸例如是未取代或取代的、例如卤代的 C_1 - C_4 烷基磺酸或芳基磺酸，如甲磺酸或对甲苯磺酸。另外，含至少一个酸性基团的式(I)化合物还可与碱形成盐。

适宜的与碱形成的盐例如是金属盐如碱金属盐和碱土金属盐，例如钠盐、钾盐和镁盐；以及与氨或有机胺形成的盐，例如吗啉、哌啶、吡咯烷、单、二或三低级烷基胺如乙胺、二乙胺、三乙胺或二甲基丙胺或者单、二或三羟基低级烷基胺如乙醇胺、二乙醇胺或三乙醇胺。另外，也可任意地形成相应的内盐。首先优选是游离形式。在式(I)化合物的盐中，优选在农业化学方面有利的盐。在上下文中，游离式(I)化合物及其盐适当时可分别理解为包括式(I)化合物相应的盐和游离形式二者。这对于式(I)化合物的互变异构体及其盐也是如此。

除非特别定义，在上下文中所用的一般术语具有下述含义。

芳基为苯基或萘基。

杂芳基为吡啶基、嘧啶基、s-三嗪基、1,2,4-三嗪基、噻吩基、呋喃基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、噻唑基、三唑基、噁唑基、噻二唑基、噁二唑基、苯并噻吩基、苯并呋喃基、苯并噻唑基、吲哚基或吲唑基，优选为吡啶基、嘧啶基、s-三嗪基或1,2,4-三嗪基，特别是吡啶基或嘧啶基。

烷基——作为基团本身和作为其它基团和化合物如卤代烷基、烷氧基和烷硫基的结构单元——在每种情况下根据实际情形考虑相应的基团或化合物中所含的碳原子数，可以是直链或支链的，直链烷基即甲基、乙基、丙基、丁基、戊基、己基、庚基或辛基，支链烷基如异丙基、异丁基、仲丁基、叔丁基、异戊基、新戊基或异己基。

链烯基——作为基团本身和作为其它基团和化合物的结构单元——在每种情况下根据实际情形考虑相应的基团或化合物中所含的碳原子数和共轭或孤立双键的数目，可以是直链或支链的，直链链烯基例如是烯丙基、2-丁烯基、3-戊烯基、1-己烯基、1-庚烯基、1,3-己二烯基或1,3-辛二烯基，支链链烯基例如是异丙烯基、异丁烯基、异戊烯基、叔戊烯基、异己烯基、异庚烯基或异辛烯基。

炔基——作为基团本身和作为其它基团和化合物的结构单元——在每种情况下根据实际情形考虑相应的基团或化合物中所含的碳原子数和共轭或孤立双键的数目，可以是直链或支链的，直链炔基例如是炔丙基、2-丁炔基、3-戊炔基、1-己炔基、1-庚炔基、3-己烯-1-炔基或1,5-庚二烯-3-炔基，

支链炔基例如是3-甲基丁-1-炔基、4-乙基戊-1-炔基、4-甲基己-2-炔基或2-甲基庚-3-炔基。

环烷基——作为基团本身和作为其它基团和化合物如卤代环烷基的结构单元——在每种情况下根据实际情形考虑相应的基团或化合物中所含的碳原子数，是环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基或环辛基。

卤素——作为基团本身和作为其它基团和化合物如卤代烷基、卤代烷氧基和卤代烷硫基的结构单元——为氟、氯、溴或碘，特别是氟、氯或溴，尤其是氟或氯。

卤素取代的含碳基团和化合物如卤代烷基、卤代烷氧基或卤代烷硫基可以是部分卤化或全卤化的，当为多取代时卤素取代基可以相同或不同。卤代烷基的实例——作为基团本身和作为其它基团和化合物如卤代烷氧基或卤代烷硫基的结构单元——是被氟、氯和/或溴单至三取代的甲基，如 CHF_2 或 CF_3 ；被氟、氯和/或溴单至五取代的乙基，如 CH_2CF_3 、 CF_2CF_3 、 CF_2CCl_3 、 CF_2CHCl_2 、 CF_2CHF_2 、 CF_2CFCl_2 、 CF_2CHBr_2 、 CF_2CHClF 、 CH_2CHBrF 或 CClFCHClF ；被氟、氯和/或溴单至七取代的丙基或异丙基，如 $\text{CH}_2\text{CHBrCH}_2\text{Br}$ 、 $\text{CF}_2\text{CHFCH}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 或 $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$ ；被氟、氯和/或溴单至九取代的丁基或其异构体，如 $\text{CF}(\text{CF}_3)\text{CHFCH}_2\text{CF}_3$ 或 $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$ ；被氟、氯和/或溴单至十一取代的戊基或其异构体，如 $\text{CF}(\text{CF}_3)(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ 或 $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ ；以及被氟、氯和/或溴单至十三取代的己基或其异构体，如 $(\text{CH}_2)_4\text{CHBrCH}_2\text{Br}$ 、 $\text{CF}_2(\text{CHF})_4\text{CF}_3$ 、 $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_4\text{CF}_3$ 或 $\text{C}(\text{CF}_3)_2(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ 。

烷氧基的链长优选为1至6个碳原子。烷氧基例如是甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基和叔丁氧基，以及异构体戊氧基和己氧基；优选甲氧基和乙氧基。卤代烷氧基的链长优选为1至6个碳原子。卤代烷氧基例如是氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2,2-三氟乙氧基、1,1,2,2-四氟乙氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2,2-二氟乙氧基和2,2,2-三氟乙氧基；优选二氟甲氧基、2-氯乙氧基和三氟甲氧基。

烷硫基的链长优选为1至6个碳原子。烷硫基例如是甲硫基、乙硫基、丙硫基、异丙硫基、正丁硫基、异丁硫基、仲丁硫基或叔丁硫基，优选甲

硫基和乙硫基。

考虑上述条件，本发明上下文中的优选实施方案是：

(1)式(I)化合物，其中 R_1 为未取代或被 R_7 单至五取代的芳基，如果取代基的数目大于1，则它们在每种情况下可以相同或不同；特别是被 R_7 单至三取代的芳基，如果取代基的数目大于1，则它们在每种情况下可以相同或不同；

(2)式(I)化合物，其中 R_2 为 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、在每种情况下为未取代或被 R_7 单至多取代的芳基或杂芳基，其中如果取代基的数目大于1，则它们在每种情况下可以相同或不同；特别是 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基或未取代或被 R_7 单至五取代的芳基，其中如果取代基的数目大于1，则它们可以相同或不同；非常特别是未取代或被 R_7 单至三取代的芳基，其中如果取代基的数目大于1，则它们可以相同或不同；

(3)式(I)化合物，其中 R_3 为氢或 C_1 - C_6 烷基；特别是氢或 C_1 - C_4 烷基；非常特别是氢；

(4)式(I)化合物，其中 R_4 、 R_5 和 R_6 彼此独立地为氢、 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、卤代- C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 环烷基；特别是氢、 C_1 - C_4 烷基、卤代- C_1 - C_4 烷基或 C_3 - C_6 环烷基；非常特别是氢或 C_1 - C_2 烷基；

(5)式(I)化合物，其中 R_7 为卤素、 C_1 - C_4 烷基、卤代- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、卤代- C_1 - C_4 烷氧基；在每种情况下为未取代或单或多取代的芳基或苯基乙炔基，其中取代基选自卤素、 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、卤代- C_1 - C_6 烷氧基，且如果取代基的数目大于1，则它们在每种情况下可以相同或不同；特别是卤素、 C_1 - C_2 烷基、卤代- C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 烷氧基、卤代- C_1 - C_2 烷氧基；非常特别是卤素或卤代- C_1 - C_2 烷基；

(6)式(I)化合物，其中 R_8 为未取代或单至三取代的芳基，其中取代基选自卤素、 C_1 - C_4 烷基、卤代- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基和卤代- C_1 - C_4 烷氧基，且如果取代基的数目大于1，则它们可以相同或不同；特别是单至三取代的芳基，其中取代基选自卤素、 C_1 - C_2 烷基、卤代- C_1 - C_2 烷基和卤代- C_1 - C_2 烷氧基，且如果取代基的数目大于1，则它们可以相同或不同；非常特别是单

或二取代的芳基，其中取代基选自卤素和卤代-C₁-C₂烷基，且如果取代基的数目大于1，则它们可以相同或不同；

(7)式(I)化合物，其中X为O或S；特别是O；

(8)式(I)化合物，其中X为O或S；特别是n是1；

(9)式(I)化合物，其中R₁为未取代被R₇单或五取代的芳基，其中如果取代基的数目大于1，则它们在每种情况下可以相同或不同；R₂为C₁-C₆烷基、卤代-C₁-C₆烷基、芳基或杂芳基，在每种情况下是未取代或被R₇单或多取代的，其中如果取代基的数目大于1，则它们在每种情况下可以相同或不同；R₃为氢或C₁-C₆烷基；R₄、R₅和R₆彼此独立地为氢、C₁-C₆烷基、卤代-C₁-C₆烷基、C₁-C₆烷氧基、卤代-C₁-C₆烷氧基、C₂-C₆链烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₆环烷基；R₇为卤素、C₁-C₄烷基、卤代-C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基、卤代-C₁-C₄烷氧基、在每种情况下为未取代或单或多取代的芳基或苯基乙炔基，其中取代基选自卤素、C₁-C₆烷基、卤代-C₁-C₆烷基、C₁-C₆烷氧基、卤代-C₁-C₆烷氧基，且如果取代基的数目大于1，则它们在每种情况下可以相同或不同；R₈为未取代或单至三取代的芳基，其中取代基选自卤素、C₁-C₄烷基、卤代-C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基和卤代-C₁-C₄烷氧基，且如果取代基的数目大于1，则它们可以相同或不同；X为O或S且n为1；

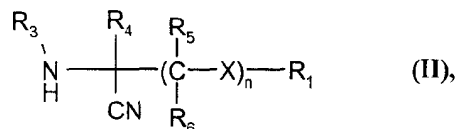
(10)式(I)化合物，其中R₁为被R₇单或三取代的芳基，其中如果取代基的数目大于1，则它们在每种情况下可以相同或不同；R₂为C₁-C₆烷基、卤代-C₁-C₆烷基或未取代或被R₇单至五取代的芳基，其中如果取代基的数目大于1，则它们可以相同或不同；R₃为氢或C₁-C₄烷基；R₄、R₅和R₆彼此独立地为氢、C₁-C₄烷基、卤代-C₁-C₄烷基或C₃-C₆环烷基；R₇为卤素、C₁-C₂烷基、卤代-C₁-C₂烷基、C₁-C₂烷氧基或卤代-C₁-C₂烷氧基；R₈为单至三取代的芳基，其中取代基选自卤素、C₁-C₂烷基、卤代-C₁-C₂烷基和卤代-C₁-C₂烷氧基，且如果取代基的数目大于1，则它们可以相同或不同；X为O且n为1；

(11)式(I)化合物，其中R₁为被R₇单至三取代的芳基，其中如果取代基的数目大于1，则它们在每种情况下可以相同或不同；R₂为未取代或被R₇单或三取代的芳基，其中如果取代基的数目大于1，则它们在每种情况下可

以相同或不同； R_3 为氢； R_4 、 R_5 和 R_6 彼此独立地为氢或 C_1 - C_2 烷基； R_7 为卤素或卤代- C_1 - C_2 烷基； R_8 为单或二取代的芳基，其中取代基选自卤素和卤代- C_1 - C_2 烷基，且如果取代基的数目大于1，则它们可以相同或不同； X 为O且 n 为1。

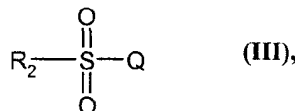
为本发明的目的特别优选的式(I)化合物是表1和表2中列出的化合物，非常特别优选在合成实施例中提到的式(I)化合物。

本发明的另一主题是式(I)化合物的制备方法，所述式(I)化合物在每种情况下为游离形式或盐形式，其特征在于使已知或可类似于相应已知化合物制备的式(II)化合物



其中 R_1 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 X 和 n 如式(I)中定义，

与已知或可类似于相应已知化合物制备的式(III)化合物反应，



其中 R_2 如式(I)中定义且 Q 为离去基团，如果合适的话，在碱性催化剂存在下反应，并且在每种情况下如果需要，将根据该方法或其它方法可得到的、在每种情况下为游离形式或盐形式的式(I)化合物转化为另一种式(I)化合物，将根据该方法可得到的异构体混合物分离并分离出需要的异构体和/或将根据该方法可得到的游离式(I)化合物转化为盐，或者将根据该方法可得到的式(I)化合物的盐转化为游离式(I)化合物或另一种盐。

对于上下文中提到的原料，就其盐而言，上文有关式(I)化合物的盐所述以相似方式适用。

反应物可彼此在不加入溶剂或稀释剂的条件下进行反应，例如在熔化时进行反应。然而，加入惰性溶剂或稀释剂或它们的混合物通常是有利的。所述可提及的溶剂或稀释剂的实例为：芳香烃、脂肪烃、脂环烃和卤代烃，例如苯、甲苯、二甲苯、1,3,5-三甲苯、四氢萘、氯苯、二氯苯、溴苯、石油醚、己烷、环己烷、二氯甲烷、三氯甲烷、四氯甲烷、二氯乙烷、三氯

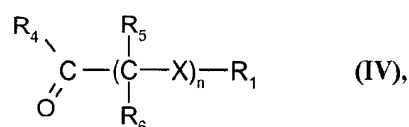
乙烯或四氯乙烯；醚，例如二乙醚、二丙醚、二异丙醚、二丁醚、叔丁基甲基醚、乙二醇单甲醚、乙二醇单乙醚、乙二醇二甲醚、二甲氧基二乙基醚、四氢呋喃或二噁烷；酮，例如丙酮、甲乙酮或甲基异丁基酮；酰胺，例如N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二乙基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲基磷酰胺；腈，例如乙腈或丙腈；以及亚砷，例如二甲基亚砷。

优选的离去基团为卤素，特别是氯。

促进反应的适宜碱例如是碱金属或碱土金属的氢氧化物、氢化物、氨基化物、醇盐、醋酸盐、碳酸盐、二烷基氨基化物或烷基甲硅烷基氨基化物、烷基胺、烷撑二胺、游离或N-烷基化的不饱和或饱和的环烷基胺、碱性杂环、氢氧化铵和碳环胺。可提及的实例是氢氧化钠、氯化钠、氨基化钠、甲醇钠、醋酸钠、碳酸钠、叔丁醇钾、氢氧化钾、碳酸钾、氯化钾、二异丙基氨基化锂、二(三甲基甲硅烷基)氨基化钾、氯化钙、三乙胺、二异丙胺、三亚乙基二胺、环己胺、N-环己基-N,N-二甲胺、N,N-二乙苯胺、吡啶、4-(N,N-二甲氨基)吡啶、喹核碱、N-甲基吗啉、苄基三甲基氢氧化铵和1,5-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-5-烯(DBU)。

反应有利地在温度约 0℃ 至约 +150℃ 下进行，优选在约 20℃ 至约 +100℃ 下进行。

本发明的另一主题是式(II)化合物的制备方法，所述式(II)化合物在每种情况下为游离形式或盐形式，其特征在于使已知或可类似于相应已知化合物制备的式(IV)化合物



其中R₁、R₄、R₅、R₆、X和n如式(I)中定义，

与无机或有机氟化物和已知或可类似于相应已知化合物制备的式 R₃-NH₂ 化合物反应，其中 R₃ 如式(I)中定义，并且在每种情况下如果需要，将根据本发明或其它方法可得到的、在每种情况下为游离形式或盐形式的式(II)化合物转化为另一种式(II)化合物，将根据该方法可获得的异构体混合物分离并分离出需要的异构体和/或将根据该方法可得到的游离式(II)化合物转

化为盐，或者将根据该方法可得到的式(II)化合物的盐转化为游离式(II)化合物或另一种盐。

适宜的氟化物为氟化钠、氟化钾、氟化三甲基硅烷和丙酮合氟化氢。

根据该方法或另一种方法可获得的式(I)化合物可以以本身已知的方法、用本发明的一种或多种其它取代基以常规方法替代式(I)起始化合物的一个或多个取代基而转化为不同的式(I)化合物。

根据在每种情况下选择的适宜反应条件和起始物质，在一步反应步骤中可能用本发明的另一取代基仅替代一个取代基，或者可能在同一反应步骤中用本发明的其它取代基替代多个取代基。

式(I)化合物的盐可按照本身已知的方法制备。例如，式(I)化合物的酸加成盐可通过用适宜的酸或适宜的离子交换剂处理得到，碱盐可通过用适宜的碱或适宜的离子交换剂处理得到。

式(I)化合物的盐可按照常规方法转化为游离式(I)化合物；酸加成盐例如可通过用适宜的碱性介质或适宜的离子交换剂处理而转化，碱盐可例如通过适宜的酸或适宜的离子交换剂处理而转化。

式(I)化合物的盐可以以本身已知的方法转化为式(I)化合物的不同盐；例如酸加成盐可转化为不同的酸加成盐，例如通过将无机酸的盐如盐酸盐用金属与酸形成的适宜盐如钠盐、钡盐或银盐、例如用醋酸银在形成的无机盐例如氯化银在其中不可溶并且因此可从反应混合物中沉淀出来的适宜溶剂中转化而得。

根据方法和/或反应条件，具有成盐性质的式(I)化合物可以以游离形式或盐形式获得。

式(I)化合物也可以以其水合物的形式获得，和/或可包括其它溶剂，例如可用于固态形式的化合物结晶的任何溶剂。

式(I)和式(II)化合物可以是可能的异构体之一形式或其混合物的形式，例如取决于不对称碳原子的数目以及绝对构型和相对构型，或者是纯异构体形式，例如对映体和/或非对映异构体，或者是异构体混合物的形式，例如对映体混合物如外消旋体、非对映异构体混合物或者外消旋体混合物；本发明涉及纯的异构体和所有可能的异构体混合物二者，这在上下文中应

当相应地理解，即使在每种情形下没有明确提到立体化学的细节。

根据该方法——取决于所选择的原料和方法——或其它方法可得到的式(I)和式(II)化合物的非对映异构体混合物和外消旋体混合物可按照已知方法、根据组分之间的物理化学差异而分离成纯的非对映异构体或者外消旋体，例如通过分步结晶、蒸馏和/或色谱法而分离。

如此可获得的对映体或外消旋体的混合物可通过已知方法被分离为旋光对映体，例如通过从旋光活性溶剂中重结晶、通过手性吸附剂色谱法例如醋酸纤维素高压液相色谱(HPLC)、借助适宜的微生物、通过用特定的固定酶裂解或例如使用手性冠醚通过形成包合化合物，在上述情形下仅结合一种对映体。

纯的非对映异构体和对映异构体不仅可通过分离相应的异构体混合物而获得，而且根据本发明还可通过众所周知的非对映异构体和对映异构体选择性合成法获得，例如通过使用具有适当的立体化学的原料进行本发明的方法而获得。

在各个组分具有不同生物学活性的情况下，分离或合成任何一种生物学更具活性的异构体如对映体或异构体的混合物如对映体的混合物是有利的。

在本发明的方法中，优选使用那些能生成在开始部分所描述的特别重要的式(I)化合物的原料和中间体。

本发明特别涉及实施例中所描述的制备方法。

本发明还涉及根据本发明在制备式(I)化合物中使用的新的原料和中间体、它们的用途以及制备它们的方法。

在害虫防治领域，本发明的式(I)化合物即使在较低的浓度比率下仍然是具有有价值的预防和/或治疗活性的、具有非常有利的杀生物谱的活性成分，同时被温血生物体、鱼和植物良好地耐受。该化合物特别适合用于防治动物的体内和体外寄生虫和植物害虫以及蜱螨目的代表。本发明的活性成分可有效对抗常规敏感性动物害虫以及耐药的动物害虫如昆虫和蜱螨目的代表的所有或各个发育阶段。本发明的活性成分的杀虫活性可以以其本身直接证明或者间接证明，所述的直接证明即以立即发生或仅稍后发生、

例如在蜕皮期间发生的害虫死亡率证明，所述的间接证明例如以产卵和/或孵化率降低证明，良好的活性相当于死亡率为至少 50 至 60%。式(I)化合物的特征尤其在于其特别长的作用持续时间。

所述植物的动物害虫包括欧洲专利申请 EP-A-736252，第 5 页第 55 行至第 6 页第 55 行中提到的动物害虫。因此其中提到的害虫作为参考包括在本发明的主题内。

式(I)化合物还可用于对抗影响卫生的害虫，特别是双翅目(Diptera)的麻蝇科(Sarcophagidae)、anophilidae 和蚊科(Culicidae)的害虫；以及直翅目(Orthoptera)、网翅目(Dictyoptera)(如蜚蠊科(Blattidae))和膜翅目(Hymenoptera)(如蚁科(Formicidae))的害虫。

式(I)化合物还对作为植物寄生虫的螨类和昆虫具有长效活性。对于蛛螨目的珠螨，它们可有效对抗叶螨科(Tetranychidae)(四爪螨属(Tetranychus spp.)和全爪螨属(Panonychus spp.))的卵、若虫和成虫。

它们对以下害虫具有高度活性：同翅目(Homoptera)的吸血昆虫、特别是对蚜科(Aphididae)、飞虱科(Delphacidae)、大叶蝉科(Cicadellidae)、木虱科(Psyllidae)、Loccidae、盾蚧科(Diaspididae)和瘿螨科(Eriophyidae)(例如柑桔类水果上的锈螨)害虫、半翅目(Hemiptera)、异翅亚目(Heteroptera)和缨翅目(Thysanoptera)的吸血昆虫，以及鳞翅目(Lepidoptera)、鞘翅目(Coleoptera)、双翅目(Diptera)和直翅目的植食性昆虫。

它们还适合用作对抗土壤中害虫的土壤杀虫剂。

本发明的化合物可用于防治、即抑制或者消灭特别在植物、更特别在农业、园艺和林学植物上有用的植物和观赏植物中出现的所提及类型的害虫，或者是在该植物的一部分如果实、花、叶、茎、块茎或根上出现的所提及类型的害虫，而在某些情形下还可保护后生长出的植物部分不受所述害虫的破坏。

因此式(I)化合物可有效对抗如以下农作物上的吸血昆虫和植食性昆虫的所有发育阶段：谷类如小麦、大麦、黑麦、燕麦、稻、玉蜀黍和高粱；甜菜如糖用甜菜和饲料甜菜；水果如梨果、核果和小果，如苹果、梨、李

子、桃、扁桃、櫻桃和漿果如草莓、樹莓(raspberry)和黑莓; 豆科植物, 如豆、兵豆、豌豆和大豆; 油料植物, 如油菜、芥菜、罌粟、橄欖、向日葵、椰子、蓖麻油、可可和花生; 葫蘆科, 例如葫蘆(marrow)、黃瓜和甜瓜; 纖維植物, 如棉花、亞麻、大麻和黃麻; 柑橘類水果, 如橙、檸檬、葡萄柚和桔子; 蔬菜, 如菠菜、萵苣、芦笋、卷心菜、胡蘿蔔、洋葱、西紅柿、馬鈴薯和紅辣椒(paprika); 樟科(lauraceae), 如鰐梨、肉桂和樟腦; 以及烟草、坚果、咖啡、茄子、甘蔗、茶叶、胡椒、葡萄、啤酒花、香蕉、天然橡胶植物和观赏植物。

式(I)化合物还可有效对抗虫瘻线虫属(Meloidogyne)、异皮线虫属(Heterodera)、短体线虫属(Pratylenchus)、茎线虫属(Ditylenchus)、穿孔线虫属(Radopholus)、rizoglyphus 及其它属的植物线虫。

在本发明的上下文中, 在温血生物体上作为寄生虫出现的体外寄生虫应理解为特别指昆虫、螨和蜱。其包括以下昆虫目: 鳞翅目(Lepidoptera)、鞘翅目(Coleoptera)、同翅目(Homoptera)、异翅目(Heteroptera)、双翅目(Diptera)、缨翅目(Thysanoptera)、直翅目(Orthoptera)、虱目(Anoplura)、蚤目(Siphonaptera)、食毛目(Mallophaga)、缨尾目(Thysanura)、等翅目(Isoptera)、啮虫目(Psocoptera)和膜翅目(Hymenoptera)。但是, 可特别提及的是那些困扰人或动物且携带病原体的体外寄生虫, 例如苍蝇如家蝇(*Musca domestica*)、*Musca vetustissima*、秋家蝇(*Musca autumnalis*)、黄腹厕蝇(*Fannia canicularis*)、肉食麻蝇(*Sarcophaga carnaria*)、铜绿蝇(*Lucilia cuprina*)、牛皮下蝇(*Hypoderma bovis*)、纹皮下蝇(*Hypoderma lineatum*)、白头裸金蝇(*Chrysomya chloropyga*)、人皮蝇(*Dermatobia hominis*)、嗜人锥蝇(*Cochliomyia hominivorax*)、肠胃蝇(*Gasterophilus intestinalis*)、羊狂蝇(*Oestrus ovis*)、厩螫蝇(*Stomoxys calcitrans*)、扰血蝇(*Haematobia irritans*)和蠓(长角亚目, Nematocera), 如蚊科(Culicidae)、蚋科(Simuliidae)、毛蛉科(Psychodidae), 还包括吸血寄生虫, 例如蚤如猫栉头蚤(*Ctenocephalides felis*)和犬栉头蚤(*Ctenocephalides canis*) (猫和犬蚤)、印鼠客蚤(*Xenopsylla cheopis*)、人蚤(*Pulex irritans*)、沙蚤(*Dermatophilus penetrans*), 虱如 *Damalina ovis*、人虱(*Pediculus humanis*), 厩螫蝇和马蝇(虻科, Tabanidae),

麻虻属(*Haematopota spp.*)如高额麻虻(*Haematopota pluvialis*), 虻科属(*Tabanidea spp.*)如 *Tabanus nigrovittatus*, 斑虻属(*Chrysopsinae spp.*)如黑尾斑虻(*Chrysops caecutiens*), 舌蝇如舌蝇(*Glossinia*)属, 螫虫, 特别是蟑螂, 如德国小蠊(*Blatella germanica*)、东方蠊(*Blatta orientalis*)、美洲大蠊(*Periplaneta americana*), 螨如鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*)、疥螨(*Sarcoptes scabiei*)、羊痒螨(*Psoroptes ovis*)和生疥螨属(*Psorergates spp.*), 最后但非最不重要的是蝉。后者属于蝉螨目。已知的蝉的实例有例如牛蝉(*Boophilus*)、花蝉(*Amblyomma*)、暗眼蝉(*Anocentor*)、革蝉(*Dermacentor*)、血蝉(*Haemaphysalis*)、璃眼蝉(*Hyalomma*)、硬蝉(*Ixodes*)、扇革蝉(*Rhipicentor*)、巨足蝉属(*Margaropus*)、扇头蝉(*Rhipicephalus*)、锐缘蝉(*Argas*)、耳蝉(*Otobius*)和钝缘蝉(*Ornithodoros*)等。它们主要滋扰温血动物, 包括农场动物如牛、猪、绵羊和山羊; 家禽如鸡、火鸡和鹅; 为其皮毛而饲养的动物如貂、狐狸、南美栗鼠、家兔等; 以及家养动物如猫和狗; 还包括人。

另外, 式(I)化合物可特别有效地对抗蠕虫, 其中体内寄生线虫和吸虫是引起哺乳动物和家禽的严重疾病的原因, 所述哺乳动物和家禽例如是羊、猪、山羊、牛、马、驴、犬、猫、豚鼠以及观赏鸟。所指的典型线虫为: 血茅线虫属(*Haemonchus*)、毛圆线虫属(*Trichostrongylus*)、胃线虫属(*Ostertagia*)、细颈线虫属(*Nematodirus*)、古柏线虫属(*Cooperia*)、蛔虫属(*Ascaris*)、仰口线虫属(*Bunostomum*)、结节线虫属(*Oesophagostomum*)、夏柏特线虫属(*Chabertia*)、毛首线虫属(*Trichuris*)、圆线虫属(*Strongylus*)、毛线线虫属属(*Trichonema*)、网尾线虫属(*Dictyocaulus*)、毛细线虫属(*Capillaria*)、异刺线虫属(*Heterakis*)、弓蛔虫属(*Toxocara*)、鸡蛔虫属(*Ascaridia*)、尖尾线虫属(*Oxyuris*)、钩口线虫属(*Ancylostoma*)、钩虫属(*Uncinaria*)、弓蛔线虫属(*Toxascaris*)和副蛔虫属(*Parascaris*)。吸虫中应当特别提及的是片形科(*fasciolidea*), 特别是肝片形(*Fasciola hepatica*)吸虫。式(I)化合物的特别优点在于它们对抗对基于苯并咪唑的活性成分有耐药性的寄生虫。

某些细颈线虫属、古柏线虫属和结节线虫属的害虫侵袭宿主动物的肠

道，而其它血茅线虫属和胃线虫属的害虫在胃部寄生，那些网尾线虫属的害虫寄生于肺组织中。在内部细胞组织和器官例如心脏、血管、淋巴管和皮下组织中可发现丝虫科(Filariidae)和腹腔丝虫科(Setariidae)的寄生虫。在这方面，应当特别提及狗的心丝虫，即犬恶丝虫(*Dirofilaria immitis*)。式(I)化合物可高度有效地对抗所述寄生虫。

此外，式(I)化合物适于控制作为人病原体的寄生虫，其中，作为在消化道出现的典型代表，应当提到是钩口线虫属、板口丝虫属(*Necator*)、蛔虫属、类圆线虫属(*Strongyloides*)、毛形线虫属(*Trichinella*)、毛细线虫属、毛首线虫属和蛲虫属(*Enterobius*)的寄生虫。本发明的化合物还可有效对抗血液、组织和各种器官中出现的丝虫科的吴策线虫属(*Wuchereria*)、布氏丝虫属(*Brugia*)、盘尾线虫属(*Onchocerca*)和罗阿丝虫属(*Loa*)的寄生虫，并且还可对抗龙线虫属(*Dracunculus*)以及特别感染胃肠道的类圆线虫属和毛形线虫属的寄生虫。

在农作物保护领域，式(I)化合物可以以未修饰的形式使用，或者优选与制剂技术中常用的辅助剂一起使用，因此可按照已知方法将其制成如可乳化的浓缩物(emulsifiable concentrates)、可直接稀释的溶液、稀乳剂、可溶性粉末、颗粒以及聚物质中的微囊剂(encapsulation)。根据组合物的性质，其使用方法可根据预期目标和主要情形进行选择。

本发明还涉及杀虫剂，例如可乳化浓缩物、混悬浓缩物(suspension concentrate)、可直接喷雾或稀释的溶液、可包衣糊剂、稀乳剂、可湿性粉末、可溶性粉末、可分散性粉末、可湿性粉末、粉剂(dust)、颗粒或聚物质中的微囊剂，所述杀虫剂含有至少一种本发明的活性成分，制剂类型根据预期目标和主要情形进行选择。它们可通过已知方法制备，例如通过将活性成分与增容剂均匀混合和/或研磨，例如与溶剂、固态载体和任选的表面活性化合物(表面活性剂)均匀混合和/或研磨。

活性成分可以以纯的形式、即固态活性成分例如具有特定粒径的固态活性成分用于那些组合物中，或者优选与至少一种制剂技术领域的常规辅助剂如增容剂例如溶剂或固态载体或表面活性化合物(表面活性剂)一起使用。

作为制剂辅助剂，使用例如固态载体、溶剂、稳定剂、“缓释”辅助剂、染料和任意的表面活性物质(表面活性剂)。适宜的载体和辅助剂包括在农作物保护产品、特别是在蜗牛和蛞蝓型幼虫防治产品中常规使用的所有物质。根据本发明在组合物使用的适宜辅助剂例如溶剂、固态载体、表面活性化合物、非离子型表面活性剂、阳离子表面活性剂、阴离子表面活性剂以及其它辅助剂包括例如 EP-A-736252，第 7 页第 51 行至第 8 页第 39 行中所描述的那些辅助剂。它们作为参考被包括在本发明的主题内。

用于农作物保护的组合物通常含有 0.1 至 99%重量、特别是 0.1 至 95%重量的活性成分和 1 至 99.9%重量、特别是 5 至 99.9%重量的至少一种固态或液态辅助剂，通常组合物的 0 至 25%重量、特别是 0.1 至 20%可能为表面活性剂。而优选将商品制成浓缩物，终端用户通常可使用活性成分浓度低得多的稀释制剂。用于农作物保护的优选组合物特别具有下述组成(% = %重量):

可乳化浓缩物:

活性成分: 1 至 95 %，优选为 5 至 20 %
 表面活性剂: 1 至 30 %，优选为 10 至 20 %
 溶剂: 5 至 98 %，优选为 70 至 85 %

粉剂:

活性成分: 0.1 至 10 %，优选为 0.1 至 1 %
 固态载体: 99.9 至 90 %，优选为 99.9 至 99 %

混悬浓缩物:

活性成分: 5 至 75 %，优选为 10 至 50 %
 水: 94 至 24 %，优选为 88 至 30%
 表面活性剂: 1 至 40%，优选为 2 至 30%

可湿性粉末:

活性成分: 0.5 至 90 %，优选为 1 至 80 %
 表面活性剂: 0.5 至 20 %，优选为 1 至 15%
 固态载体: 5 至 99 %，优选为 15 至 98%

颗粒:

活性成分:	0.5 至 30%，优选为 3 至 15%
固态载体:	99.5 至 70%，优选为 97 至 85%

用于防治温血生物体体内和体表的动物寄生虫的本发明的驱虫组合物通常含有 0.1 至 99% 重量、特别是 0.1 至 95% 重量的式(I)化合物, 99.9 至 1% 重量、特别是 99.8 至 5% 重量的固态或液态辅助剂, 所述辅助剂包括 0 至 25% 重量、特别是 0.1 至 25% 重量的表面活性剂。

用于在温血生物体中防治蠕虫的优选的施用形式包括溶液、乳剂、混悬液(顿服剂)、饲料添加剂、粉末、片剂(包括泡腾片)、大丸剂、胶囊、微囊和浇淋(pour-on)制剂, 其中必须确保制剂辅助剂是生理可耐受的。

在防治动物寄生虫的制剂中使用的适宜溶剂例如是: 醇类如乙醇、丙醇或丁醇, 二元醇类及其醚和酯, 如丙二醇、二丙二醇醚、乙二醇、乙二醇单甲基醚或单乙基醚, 酮类如环己酮、异佛尔酮或双丙酮醇, 强极性溶剂如 N-甲基-2-吡咯烷酮、二甲亚砜或二甲基甲酰胺或水, 植物油如菜籽油、蓖麻油、椰子油或大豆油以及(如果适合)硅油。

用于片剂和大丸剂的适宜粘合剂是经化学修饰的可溶于水或醇的天然聚物质, 例如淀粉、纤维素或蛋白质衍生物(如甲基纤维素、羧甲基纤维素、乙基羟乙基纤维素、蛋白质类如玉米醇溶蛋白、明胶等)、以及合成聚合物如聚乙烯醇、聚乙烯吡咯烷酮等。片剂还含有填充剂(如淀粉、微晶纤维素、糖、乳糖等)、润滑剂以及崩解剂。

当驱虫组合物为饲料浓缩物的形式时, 可用作载体的例如是高效饲料(performance feeds)、谷物饲料或蛋白浓缩物。除活性成分外, 该饲料浓缩物或组合物还可以含有辅助剂、维生素、抗生素、化疗药物或其它杀虫剂, 特别是抑菌剂、抑真菌剂、球虫抑制剂和激素制品、具有合成代谢作用的物质或促进生长、影响所屠宰动物的肉质或以某种其它方式有利于生物体的物质。当将组合物或其中所含的式(I)化合物直接加入饲料或饮水器中时, 则最终的饲料或饮水器中含有活性成分的浓度优选为 0.0005 至 0.02 % 重量(5-200ppm)。

本发明的式(I)化合物可单独使用或者与其它杀生物剂合用。例如,为了提高效应,它们可与具有相同作用方向的杀虫剂组合,或者为了扩宽活性范围,与具有不同作用方向的物质组合。加入所谓的“驱避剂”也是有利的。当希望将活性范围扩宽至体内寄生虫如蠕虫时,可有利地将式(I)化合物与具有杀体内寄生虫性质的物质组合。当然它们也可与抗菌剂组合使用。由于式(I)化合物是“杀成虫剂”,即由于它们可特别有效地对抗成虫期的目标寄生虫,加入可更有效对抗幼虫期寄生虫的杀虫剂可能是非常有利的,因为这样可覆盖大部分能引起巨大经济损失的寄生虫,而且显著有助于避免形成耐药性。一些组合也可产生协同效应,也就是说可以减少所用活性物质的总量,这从生态学观点来看是可取的。优选的组合伙伴和特别优选的组合伙伴在下文中提到;该组合除式(I)化合物外还可包括一种或多种这些组合伙伴。

用于农作物保护和用于防治温血生物体的体内和体外寄生虫的适宜组合伙伴为杀生物剂,例如下文中提到的且对本领域技术人员是充分已知的具有不同的作用机制的杀昆虫剂和杀螨剂,例如甲壳质合成抑制剂、生长调节剂;以与保幼激素相同的方式起作用的活性成分;作为杀成虫剂起作用的活性成分;广谱杀昆虫剂、广谱杀螨剂和杀线虫剂;以及众所周知的驱虫剂和驱逐昆虫和/或蠕虫的物质、所述的驱避剂和脱附剂(detacher)。

适宜的杀昆虫剂和杀螨剂的实例为唑啉磷、毒虫畏、氟氰菊酯和高顺式(high-cis)氟氰菊酯、灭蝇胺、杀螨硫隆、二嗪农、敌敌畏、百治磷、dicyclanil、双氧威、氟啶蟬脲、吡啶威、氟唑磷、碘硫磷、蒙七七七、氟丙氧脲、虫螨畏(methacriphos)、杀扑磷、久效磷、磷胺、丙溴磷、噁茂醚、从苏云金芽胞杆菌株 GC91 或菌株 NCTC11821 中得到的物质、拒嗪酮、溴螨酯、蒙五一五、disulfuton、啞硫磷、氟胺氟菊酯、硫环杀、二甲硫吸磷、涕灭威、谷硫磷、丙硫克百威、氟氰菊酯、噻嗪酮、卡巴呋喃、dibutylaminothio、克虫普、定虫隆、毒死蜱、氟氟氟菊酯、氟氟氟菊酯、甲体氟氟菊酯、己体氟氟菊酯、溴氟菊酯、氟脲杀、硫丹、苯虫威、杀螟硫磷、丁苯威、杀灭菊酯、安果、灭虫威、庚虫磷、吡虫啉、异丙威、甲胺磷、灭多虫、速灭磷、对硫磷、甲基对硫磷、伏杀磷、抗蚜威、残杀威、

伏虫隆、特丁磷、啉蚜威、丁苯威、双苯酰肼、锐劲特、 β -氟氯氰菊酯、灭虫硅醚、啉螨酯、啉螨酮、啉螨醚、蚊蝇醚、噻胺苯醚、硝胺烯啉、吡虫清、齐墩螨素(阿维菌素 B₁)、甲氨基阿维菌素 B₁(emamectin)、甲氨基阿维菌素 B₁ 苯甲酸盐、艾克敌 105、对昆虫有活性的植物提取物、含对昆虫有活性的线虫的制剂、可得自枯草杆菌(*Bacillus subtilis*)的制剂、含对昆虫有活性的真菌的制剂、含对昆虫有活性的病毒的制剂、氟啉虫清、高灭磷、氟酯菊酯、棉铃威、甲体氯氰菊酯、虫螨脒、Az 60541、谷硫磷 A、谷硫磷 M、啉环锡、噁虫威、杀虫磺、 β -氟氯氰菊酯、BPMC、brofenprox、溴硫磷 A、合杀威、butocarboxin、丁基啉螨灵(butylpyridaben)、硫线磷、甲萘威、三硫磷、chloethocarb、壤虫氯磷、氯甲磷、顺式苜蓿菊酯、三氟氯氰菊酯(clocythrins)、四螨嗪、杀螟脲、乙氰菊酯、三环锡、内吸磷 M、内吸磷 S、甲基内吸磷、除线磷、dicliphos、乙硫磷、乐果、甲基毒虫畏、敌杀磷、克瘟散、高氟戊菊酯、乙硫磷、醚菊酯、灭克磷、乙噻硫磷(etrinphos)、克线磷、杀螨锡、苯硫威、甲氰菊酯、吡啉胺(fenpyrad)、倍硫磷、氟啉胺、氟啉脲、氟啉戊菊酯、氟虫脲、氟丙苄醚、地虫磷、噻啉酮磷、fubfenprox、HCH、氟铃脲、噻啉酮、IKI-220、异稻瘟净、丙胺磷、异噁啉磷、伊维菌素(ivermectin)、马拉硫磷、灭蚜磷、甲亚砷磷(mesulfenphos)、蜗牛敌、速灭威、米尔螨素、莫昔克丁(moxidectin)、二溴磷、NC 184、氧乐果、甲氧叉威、砷吸磷(oxydemeton M)、异砷磷、氯菊酯、稻丰散、甲拌磷、亚胺硫磷、膈膈磷、虫螨磷 M、虫螨磷 E、猛杀威、丙虫磷、丙硫磷、发果、吡啉硫磷(pyrachlophos)、pyrada-phenthion、反灭虫菊、除虫菊、对苯酰肼、水杨硫磷、硫线磷、治螟磷、乙丙硫磷、吡啉胺、噻丙磷、七氟菊酯、双硫磷、叔丁威、杀虫畏、噻虫啉(thiacloprid)、thiafenox、噻虫啉(thiamethoxam)、硫双灭多威、特氟叉威、硫磷啉、敌贝特、四溴菊酯、triarthene、三啉磷、triazuron、敌百虫、杀虫隆、混杀威、蚜灭多、灭杀威、Yi5301/5302、zetamethrin、DPX-MP062-噁二啉虫、甲氧苯酰肼、联苯肼酯、XMC(3,5-二甲苯基氨基甲酸甲酯)或真菌病原体绿僵菌(*Metarhizium Anisopliae*)。所提及的组合伙伴对本领域熟练技术人员是众所周知的。大多数在各种版本的杀虫剂手册(英国作物保护协会, 伦

敦)中有描述, 而其它在各种版本的默克索引(Merck & Co., Inc., Rahway, 新泽西, USA)或专利文献中有描述。

在下文中提到了可加入组合物的适宜驱虫剂的实例, 其中许多实例除了具有驱虫活性外, 还具有杀昆虫和杀螨活性, 某些已经在上表中提到:

(A1)吡喹酮(Praziquantel)=2-环己基羰基-4-氧代-1,2,3,6,7,11b-六氢-4H-吡嗪并[2,1- α]异喹啉

(A2)氯氟碘柳胺(Closantel)=3,5-二碘代-N-[5-氯-2-甲基-4-(α -氟基-4-氯苄基)苯基]水杨酰胺

(A3)三氯苯哒唑(Triclabendazole)=5-氯-6-(2,3-二氯苯氧基)-2-甲硫基-1H-苯并咪唑

(A4)左旋咪唑=L-(-)-2,3,5,6-四氢-6-苯基咪唑并[2,1b]噻唑

(A5)甲苯达唑=(5-苯甲酰基-1H-苯并咪唑-2-基)氨基甲酸甲酯

(A6)Omphalotin=WO 97/20857 中所述的真菌奥尔类脐菇(*Omphalotus olearius*)的大环发酵产品

(A7)齐墩螨素=阿维菌素 B1(ivermectin B1)

(A8)伊维菌素=22,23-二氢阿维菌素 B1

(A9)莫昔克丁=5-O-脱甲基-28-脱氧-25-(1,3-二甲基-1-丁烯基)-6,28-环氧-23-(甲氧基亚氨基)-米尔倍霉素 B

(A10)多拉菌素(Doramectin)=25-环己基-5-O-脱甲基-25-脱(1-甲基丙基)-阿维菌素 A1a(ivermectin A1a)

(A11)米尔螨素=米尔倍霉素 A3 和米尔倍霉素 A4 的混合物

(A12)Milbemycin oxim=米尔倍霉素的 5-肟化合物

适宜的驱避剂和脱附剂的非限制性的例子是:

(R1)DEET=(N,N-二乙基-间-甲基苯酰胺)

(R2)KBR 3023=N-丁基-2-氧基羰基-(2-羟基)-哌啶

(R3)Cymiazole=N-2,3-二氢-3-甲基-1,3-噻唑-2-亚基-2,4-二甲苯胺

鉴于如上已经描述的, 本发明的另一重要方面涉及用于防治温血生物体上的寄生虫的组合制品, 其中所述组合制品除式(I)化合物外还含有至少一种其它具有相同或不同作用方向的活性成分和至少一种生理可耐受的载

体。本发明不局限于双组分组合。

本发明的组合物可通过局部、口服、胃肠外或皮下方式施用于所治疗的动物，所述组合物为溶液、乳剂、混悬剂(顿服剂)、粉末、片剂、大丸剂、胶囊和浇淋制剂的形式。

浇淋法或涂敷(spot-on)法包括将式(I)化合物施用于动物的皮肤或表皮的局部特定区域，最好是颈后或脊柱后的特定区域。这可例如通过将浇淋制剂或涂敷制剂擦拭或喷洒于表皮相对较小的区域来进行，由于制剂中的扩散成分，辅以动物的运动，活性成分可几乎自动分散至大面积的畜皮。

浇淋制剂和涂敷制剂可有利地含有能促进在宿主动物的皮肤表面或表皮快速分散的载体，通常以术语铺展油定义。例如适宜的载体是油性溶液、含醇和含异丙醇(如 2-辛基十二醇或油醇)的溶液、单羧酸酯(例如十四酸异丙酯、棕榈酸异丙酯、月桂酸草酸酯、油酸油基酯、油酸癸基酯、月桂酸己基酯、油基油酸酯、癸基油酸酯、链长为 $C_{12} - C_{18}$ 的饱和脂肪醇的癸酸酯)的溶液、二羧酸酯(例如邻苯二甲酸二丁酯、间苯二酸二异丙基酯、己二酸二异丙酯、己二酸二正丁基酯)的溶液或脂肪酸酯的溶液，例如二醇。可能有利的是，也可含有制药或化妆品工业中已知的分散剂。其实例为 2-吡咯烷酮、2-(N-烷基)吡咯烷酮、丙酮、聚乙二醇及其醚和酯、丙二醇或合成甘油三酯。

油性溶液包括例如植物油，如橄榄油、花生油、芝麻油、松油、亚麻子油和蓖麻油。植物油也可以是环氧化的形式。也可能使用石蜡和硅油。

通常浇淋制剂或涂敷制剂可含有 1 至 20% 重量的式(I)化合物、0.1 至 50% 重量的分散剂和 45 至 98.9% 重量的溶剂。

使用浇淋法或涂敷法对于畜群如牛、马、绵羊和猪特别有利，因为通过口服或注射方式治疗所有动物困难且耗时。由于其简便性，该方法当然也可用于所有其它动物，包括单个的家畜和宠物，并且由于其通常不需要兽医的专业帮助即可进行，因而在动物饲养员中深受欢迎。

而市售产品则优选制备成浓缩物，故终端用户通常使用稀释制剂。

该制剂还可含有其它成分，例如稳定剂、消泡剂、粘度调节剂、粘合剂和增稠剂，以及可获得特定效应的其它活性成分。

本发明还涉及终端用户使用的驱虫组合物。

在本发明的防治害虫的每种方法和本发明的每种杀虫组合物中，可使用任何空间构型的式(I)活性成分或其混合物。

本发明还包括用于预防性保护温血生物体、特别是养殖性牲畜、家畜和宠物以对抗寄生蠕虫的方法，该方法包括将式(I)活性成分或由此制得的活性成分制剂作为饲料或饮水槽的添加剂向所述动物施用，或者以固态或液态形式口服、注射或胃肠外施用。本发明还包括用于所提及方法之一的本发明的式(I)化合物。

下述实施例仅仅用于非限制性地解释本发明，短语“活性成分”指表中列出的物质之一。

用于防治温血生物体上的寄生虫的优选制剂具有下述组成：(% = 重量百分比)

<u>1. 颗粒</u>	a)	b)
表 1 或表 2 中的活性成分	5 %	10 %
高岭土	94 %	-
高度分散的硅酸	1 %	-
硅镁土	-	90 %

将活性成分溶解于二氯甲烷中，喷洒于载体上，接着在真空中蒸发出溶剂。该颗粒可混合于动物饲料中。

2. 颗粒

表 1 或表 2 中的活性成分	3 %
聚乙二醇(MW 200)	3 %
高岭土	94 %

(MW=分子量)

在混合器中将研细的活性成分均匀涂布于被聚乙二醇润湿的高岭土上。通过该方法获得无尘包衣颗粒。

3.片剂和大丸剂

I	片 1 或 2 中的活性成分	33.00%
	甲基纤维素	0.80%
	高度分散的硅酸	0.80%
	玉米淀粉	8.40%
II	结晶乳糖	22.50%
	玉米淀粉	17.00%
	微晶纤维素	16.50%
	硬脂酸镁	1.00%

- I 搅拌下将甲基纤维素加入水中。待其溶胀后，搅拌下加入硅酸，使混合物均匀悬浮。将活性成分和玉米淀粉混合。将含水悬浮液加入所得混合物中，捏制成团。由此获得的团状物过 12M 筛制粒并干燥。
- II 将所有 4 种辅料充分混合。
- III 将根据 I 和 II 得到的预混物混合，压制成片剂或大丸剂。

4.注射制剂

A. 油性载体(缓释)

- | | |
|-------------------|-----------|
| 1. 表 1 或 2 中的活性成分 | 0.1-1.0 g |
| 花生油 | 加至 100 ml |
| 2. 表 1 或 2 中的活性成分 | 0.1-1.0 g |
| 芝麻油 | 加至 100 ml |

制备：将活性成分于搅拌下溶于部分油中，任选略微加热，在冷却后将溶液补充至所需体积，用适宜的 0.22 微米薄膜滤器进行无菌过滤。

B. 水混溶性溶剂(中等释放速率)

表 1 或 2 中的活性成分	0.1-1.0 g
4-羟甲基-1,3-二氧戊环(甘油形式)	40 g
1,2-丙二醇	加至 100 ml
表 1 中的活性成分	0.1-1.0 g
二甲基酮缩甘油	40 g

1,2-丙二醇 加至 100 ml

制备: 将活性成分于搅拌下溶于部分溶剂中, 将溶液补充至所需体积, 用适宜的 0.22 微米薄膜滤器进行无菌过滤。

C. 水性增溶物(快速释放)

1. 表 1 或 2 中的活性成分	0.1-1.0 g
聚乙氧基化蓖麻油(40 个环氧乙烷单元)	10 g
1,2-丙二醇	20 g
苜醇	1 g
注射用水	加至 100 ml
2. 表 1 或 2 中的活性成分	0.1-1.0 g
聚乙氧基化失水山梨醇单油酸酯(20 个环氧乙烷单元)	8 g
4-羟甲基-1,3-二氧戊环(甘油形式)	20 g
苜醇	1 g
注射用水	加至 100 ml

制备: 将活性成分溶于溶剂和表面活性剂中, 将溶液用水补充至所需体积。接着用适宜的 0.22 微米薄膜滤器进行无菌过滤。

5. 浇淋剂

A.

表 1 或 2 中的活性成分	5g
十四酸异丙酯	10 g
异丙醇	加至 100ml

B.

表 1 或 2 中的活性成分	2 g
月桂酸己酯	5 g
中链甘油三酯	15 g
乙醇	加至 100 ml

C.

表 1 或 2 中的活性成分	2 g
----------------	-----

油酸油基酯	5 g
N-甲基-吡咯烷酮	40 g
异丙醇	加至 100 ml

该含水体系也可优选用于口服和/或瘤胃内施用。

该组合物还可含有其它成分以得到特定的效果，例如稳定剂如植物油和环氧化植物油(环氧化椰子油、菜籽油或大豆油)、消泡剂如硅油、防腐剂、粘度调节剂、粘合剂、增稠剂和肥料以及其它活性成分。

也可能在所述组合物中加入其它对式(I)化合物而言是中性的、并且对所治疗宿主没有副作用的生物活性物质或添加剂以及无机盐或维生素。

本发明的组合物可按照已知方法制备，当没有辅料存在时，例如将固态活性成分或活性成分的混合物通过研磨、过筛和/或压制至例如特定的粒径而制备，或者当存在有至少一种辅料时，例如通过将活性成分或活性成分的混合物与一种或多种辅料充分混合和/或研磨而制备。本发明还涉及制备本发明的组合物的方法以及式(I)化合物在制备这些组合物中的用途。

本发明还涉及这些组合物的使用方法，即防治所提及类型的害虫的方法，例如喷雾、雾化、撒粉、涂布、裹敷、散播或浇淋，其可根据预期目的和主要情形而选择，并且还涉及该组合物在防治所提及类型害虫中的用途。活性成分典型的浓度比例为 0.1 至 1000ppm，优选为 0.1 至 500ppm。每公顷使用的比例通常为 1 至 2000g 活性成分/公顷，特别是 10 至 1000g/ha，优选为 20 至 600g/ha。

用于农作物保护领域的优选使用方法为应用于植物的叶子(叶应用)，应用次数和频率取决于被所讨论害虫侵染的风险。然而，如果将植物所在地液态制剂浸渍或者如果将活性成分以固态形式(如颗粒形式)掺入植物所在地如土壤中(土壤应用)，则活性成分也可通过根渗透入植物(全身作用)。对于水稻作物，该颗粒可定量用于水稻田。

本发明的组合物还适合用于保护植物繁殖材料免受动物害虫的侵害，所述植物繁殖材料包括遗传改性的繁殖材料，例如种子物质如果实、块茎或谷物或植物扦插(plant cutting)。繁殖材料可在种植前用制剂处理：例如在播种前将种子拌种。本发明的化合物也可用于谷物(涂层)，或者通过将

谷物在液态制剂中浸渍或者用固态制剂涂层。该制剂也可在种植繁殖材料时用于种植场所，例如在播种时用于种子犁沟中。本发明还涉及处理植物繁殖材料的方法和如此处理的植物繁殖材料。

下述实施例用于解释本发明。它们不对本发明起限制作用。符号“h”表示“小时”。

制备实施例

N-(1-氨基-1-[2,3-二氯苯氧甲基]乙基)-C-苯基甲磺酰胺的制备

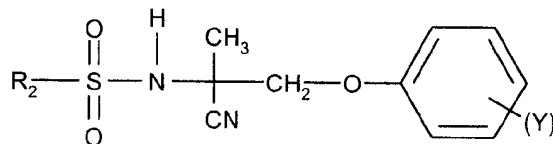
a) 将 5g 2,3-二氯苯酚、4g 2-氯丙酮、4.7g 无水碳酸钾和 450mg 碘化钾的混合物在 50ml 丙酮中回流 6h，接着冷却至室温并过滤。蒸发滤液。通过该方法获得 1-(2,3-二氯苯氧基)丙酮。

b) 将 6.5g 1-(2,3-二氯苯氧基)丙酮、1.76g 氰化钠和 2.4g 氯化铵加入 30 ml 的 25% 氨水溶液中，将混合物于室温下搅拌 24 h。接着用乙酸乙酯从混合物中萃取出粗品，分离出有机相、用水和饱和氯化钠溶液洗涤、用硫酸镁干燥并蒸发。由此获得 2-氨基-3-(2,3-二氯苯氧基)-2-甲基丙腈。

c) 将 5.2g α -甲苯磺酰氯加入 6.6g 2-氨基-3-(2,3-二氯苯氧基)-2-甲基丙腈与 4.86g 乙基二异丙胺在 50ml 二氯甲烷的混合物中，并将混合物于室温下搅拌 24 h。接着用乙酸乙酯从混合物中萃取出粗品，分离出有机相、用碳酸氢钠水溶液和饱和氯化钠溶液洗涤、用硫酸镁干燥并蒸发。将残余物通过硅胶高压柱色谱法、用己烷/乙酸乙酯(2:1)纯化。由此得到标题化合物。

下述表中提及的物质也可按照与上述方法相似的方法制备。熔点值以 $^{\circ}\text{C}$ 表示。

表 1



No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.1	CH ₃	0	H	
1.2	CH ₃	0	2-F	

No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.3	CH ₃	0	3-F	
1.4	CH ₃	0	4-F	
1.5	CH ₃	0	2-Cl	
1.6	CH ₃	0	3-Cl	
1.7	CH ₃	0	4-Cl	
1.8	CH ₃	0	2,3-Cl ₂	
1.9	CH ₃	0	2,4-Cl ₂	
1.10	CH ₃	0	2,5-Cl ₂	
1.11	CH ₃	0	2,6-Cl ₂	
1.12	CH ₃	0	3,4-Cl ₂	
1.13	CH ₃	0	3,5-Cl ₂	
1.14	CH ₃	0	3-CF ₃	
1.15	CH ₃	0	4-CF ₃	
1.16	CH ₃	1	H	
1.17	CH ₃	1	2-F	
1.18	CH ₃	1	3-F	
1.19	CH ₃	1	4-F	
1.20	CH ₃	1	2-Cl	
1.21	CH ₃	1	3-Cl	
1.22	CH ₃	1	4-Cl	
1.23	CH ₃	1	2,3-Cl ₂	
1.24	CH ₃	1	2,4-Cl ₂	
1.25	CH ₃	1	2,5-Cl ₂	
1.26	CH ₃	1	2,6-Cl ₂	
1.27	CH ₃	1	3,4-Cl ₂	
1.28	CH ₃	1	3,5-Cl ₂	
1.29	CH ₃	1	3-CF ₃	
1.30	CH ₃	1	4-CF ₃	
1.31	C ₂ H ₅	0	H	
1.32	C ₂ H ₅	0	2-F	
1.33	C ₂ H ₅	0	3-F	
1.34	C ₂ H ₅	0	4-F	

No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.35	C ₂ H ₅	0	2-Cl	
1.36	C ₂ H ₅	0	3-Cl	
1.37	C ₂ H ₅	0	4-Cl	
1.38	C ₂ H ₅	0	2,3-Cl ₂	
1.39	C ₂ H ₅	0	2,4-Cl ₂	
1.40	C ₂ H ₅	0	2,5-Cl ₂	
1.41	C ₂ H ₅	0	2,6-Cl ₂	
1.42	C ₂ H ₅	0	3,4-Cl ₂	
1.43	C ₂ H ₅	0	3,5-Cl ₂	
1.44	C ₂ H ₅	0	3-CF ₃	
1.45	C ₂ H ₅	0	4-CF ₃	
1.46	C ₂ H ₅	1	H	
1.47	C ₂ H ₅	1	2-F	
1.48	C ₂ H ₅	1	3-F	
1.49	C ₂ H ₅	1	4-F	
1.50	C ₂ H ₅	1	2-Cl	
1.51	C ₂ H ₅	1	3-Cl	
1.52	C ₂ H ₅	1	4-Cl	
1.53	C ₂ H ₅	1	2,3-Cl ₂	
1.54	C ₂ H ₅	1	2,4-Cl ₂	
1.55	C ₂ H ₅	1	2,5-Cl ₂	
1.56	C ₂ H ₅	1	2,6-Cl ₂	
1.57	C ₂ H ₅	1	3,4-Cl ₂	
1.58	C ₂ H ₅	1	3,5-Cl ₂	
1.59	C ₂ H ₅	1	3-CF ₃	
1.60	C ₂ H ₅	1	4-CF ₃	
1.61	n-C ₃ H ₇	0	H	
1.62	n-C ₃ H ₇	0	2-F	
1.63	n-C ₃ H ₇	0	3-F	
1.64	n-C ₃ H ₇	0	4-F	
1.65	n-C ₃ H ₇	0	2-Cl	
1.66	n-C ₃ H ₇	0	3-Cl	

No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.67	n-C ₃ H ₇	0	4-Cl	
1.68	n-C ₃ H ₇	0	2,3-Cl ₂	
1.69	n-C ₃ H ₇	0	2,4-Cl ₂	
1.70	n-C ₃ H ₇	0	2,5-Cl ₂	
1.71	n-C ₃ H ₇	0	2,6-Cl ₂	
1.72	n-C ₃ H ₇	0	3,4-Cl ₂	
1.73	n-C ₃ H ₇	0	3,5-Cl ₂	
1.74	n-C ₃ H ₇	0	3-CF ₃	
1.75	n-C ₃ H ₇	0	4-CF ₃	
1.76	n-C ₃ H ₇	1	H	
1.77	n-C ₃ H ₇	1	2-F	
1.78	n-C ₃ H ₇	1	3-F	
1.79	n-C ₃ H ₇	1	4-F	
1.80	n-C ₃ H ₇	1	2-Cl	
1.81	n-C ₃ H ₇	1	3-Cl	
1.82	n-C ₃ H ₇	1	4-Cl	
1.83	n-C ₃ H ₇	1	2,3-Cl ₂	
1.84	n-C ₃ H ₇	1	2,4-Cl ₂	
1.85	n-C ₃ H ₇	1	2,5-Cl ₂	
1.86	n-C ₃ H ₇	1	2,6-Cl ₂	
1.87	n-C ₃ H ₇	1	3,4-Cl ₂	
1.88	n-C ₃ H ₇	1	3,5-Cl ₂	
1.89	n-C ₃ H ₇	1	3-CF ₃	
1.90	n-C ₃ H ₇	1	4-CF ₃	
1.91	n-C ₄ H ₉	0	H	
1.92	n-C ₄ H ₉	0	2-F	
1.93	n-C ₄ H ₉	0	3-F	
1.94	n-C ₄ H ₉	0	4-F	
1.95	n-C ₄ H ₉	0	2-Cl	
1.96	n-C ₄ H ₉	0	3-Cl	
1.97	n-C ₄ H ₉	0	4-Cl	
1.98	n-C ₄ H ₉	0	2,3-Cl ₂	

No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.99	n-C ₄ H ₉	0	2,4-Cl ₂	
1.100	n-C ₄ H ₉	0	2,5-Cl ₂	
1.101	n-C ₄ H ₉	0	2,6-Cl ₂	
1.102	n-C ₄ H ₉	0	3,4-Cl ₂	
1.103	n-C ₄ H ₉	0	3,5-Cl ₂	
1.104	n-C ₄ H ₉	0	3-CF ₃	
1.105	n-C ₄ H ₉	0	4-CF ₃	
1.106	n-C ₄ H ₉	1	H	
1.107	n-C ₄ H ₉	1	2-F	
1.108	n-C ₄ H ₉	1	3-F	
1.109	n-C ₄ H ₉	1	4-F	
1.110	n-C ₄ H ₉	1	2-Cl	
1.111	n-C ₄ H ₉	1	3-Cl	
1.112	n-C ₄ H ₉	1	4-Cl	
1.113	n-C ₄ H ₉	1	2,3-Cl ₂	
1.114	n-C ₄ H ₉	1	2,4-Cl ₂	
1.115	n-C ₄ H ₉	1	2,5-Cl ₂	
1.116	n-C ₄ H ₉	1	2,6-Cl ₂	
1.117	n-C ₄ H ₉	1	3,4-Cl ₂	
1.118	n-C ₄ H ₉	1	3,5-Cl ₂	
1.119	n-C ₄ H ₉	1	3-CF ₃	
1.120	n-C ₄ H ₉	1	4-CF ₃	
1.121	CH ₂ C ₆ H ₅	0	H	
1.122	CH ₂ C ₆ H ₅	0	2-F	
1.123	CH ₂ C ₆ H ₅	0	3-F	
1.124	CH ₂ C ₆ H ₅	0	4-F	
1.125	CH ₂ C ₆ H ₅	0	2-Cl	
1.126	CH ₂ C ₆ H ₅	0	3-Cl	
1.127	CH ₂ C ₆ H ₅	0	4-Cl	
1.128	CH ₂ C ₆ H ₅	0	2,3-Cl ₂	
1.129	CH ₂ C ₆ H ₅	0	2,4-Cl ₂	
1.130	CH ₂ C ₆ H ₅	0	2,5-Cl ₂	

No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.131	CH ₂ C ₆ H ₅	0	2,6-Cl ₂	
1.132	CH ₂ C ₆ H ₅	0	3,4-Cl ₂	
1.133	CH ₂ C ₆ H ₅	0	3,5-Cl ₂	
1.134	CH ₂ C ₆ H ₅	0	3-CF ₃	
1.135	CH ₂ C ₆ H ₅	0	4-CF ₃	
1.136	CH ₂ C ₆ H ₅	1	H	
1.137	CH ₂ C ₆ H ₅	1	2-F	
1.138	CH ₂ C ₆ H ₅	1	3-F	
1.139	CH ₂ C ₆ H ₅	1	4-F	
1.140	CH ₂ C ₆ H ₅	1	2-Cl	
1.141	CH ₂ C ₆ H ₅	1	3-Cl	
1.142	CH ₂ C ₆ H ₅	1	4-Cl	
→ 1.143	CH ₂ C ₆ H ₅	1	2,3-Cl ₂	
1.144	CH ₂ C ₆ H ₅	1	2,4-Cl ₂	
1.145	CH ₂ C ₆ H ₅	1	2,5-Cl ₂	
1.146	CH ₂ C ₆ H ₅	1	2,6-Cl ₂	
1.147	CH ₂ C ₆ H ₅	1	3,4-Cl ₂	
1.148	CH ₂ C ₆ H ₅	1	3,5-Cl ₂	
1.149	CH ₂ C ₆ H ₅	1	3-CF ₃	
1.150	CH ₂ C ₆ H ₅	1	4-CF ₃	
1.151	C ₆ H ₅	0	H	
1.152	C ₆ H ₅	0	2-F	
1.153	C ₆ H ₅	0	3-F	
1.154	C ₆ H ₅	0	4-F	
1.155	C ₆ H ₅	0	2-Cl	
1.156	C ₆ H ₅	0	3-Cl	
1.157	C ₆ H ₅	0	4-Cl	
1.158	C ₆ H ₅	0	2,3-Cl ₂	
1.159	C ₆ H ₅	0	2,4-Cl ₂	
1.160	C ₆ H ₅	0	2,5-Cl ₂	
1.161	C ₆ H ₅	0	2,6-Cl ₂	
1.162	C ₆ H ₅	0	3,4-Cl ₂	

No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.163	C ₆ H ₅	0	3,5-Cl ₂	
1.164	C ₆ H ₅	0	3-CF ₃	
1.165	C ₆ H ₅	0	4-CF ₃	
1.166	C ₆ H ₅	1	H	
1.167	C ₆ H ₅	1	2-F	
1.168	C ₆ H ₅	1	3-F	
1.169	C ₆ H ₅	1	4-F	
1.170	C ₆ H ₅	1	2-Cl	
1.171	C ₆ H ₅	1	3-Cl	
1.172	C ₆ H ₅	1	4-Cl	
1.173	C ₆ H ₅	1	2,3-Cl ₂	
1.174	C ₆ H ₅	1	2,4-Cl ₂	
1.175	C ₆ H ₅	1	2,5-Cl ₂	
1.176	C ₆ H ₅	1	2,6-Cl ₂	
1.177	C ₆ H ₅	1	3,4-Cl ₂	
1.178	C ₆ H ₅	1	3,5-Cl ₂	
1.179	C ₆ H ₅	1	3-CF ₃	
1.180	C ₆ H ₅	1	4-CF ₃	
1.181	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	0	H	
1.182	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	0	2-F	
1.183	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	0	3-F	
1.184	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	0	4-F	
1.185	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	0	2-Cl	
1.186	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	0	3-Cl	
1.187	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	0	4-Cl	
1.188	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	0	2,3-Cl ₂	
1.189	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	0	2,4-Cl ₂	
1.190	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	0	2,5-Cl ₂	
1.191	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	0	2,6-Cl ₂	
1.192	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	0	3,4-Cl ₂	
1.193	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	0	3,5-Cl ₂	
1.194	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	0	3-CF ₃	

No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.195	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	0	4-CF ₃	
1.196	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	1	H	
1.197	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	1	2-F	
1.198	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	1	3-F	
1.199	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	1	4-F	
1.200	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	1	2-Cl	
1.201	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	1	3-Cl	
1.202	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	1	4-Cl	
1.203	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	1	2,3-Cl ₂	
1.204	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	1	2,4-Cl ₂	
1.205	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	1	2,5-Cl ₂	
1.206	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	1	2,6-Cl ₂	
1.207	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	1	3,4-Cl ₂	
1.208	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	1	3,5-Cl ₂	
1.209	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	1	3-CF ₃	
1.210	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	1	4-CF ₃	
1.211	C ₆ H ₄ -4-F	0	H	
1.212	C ₆ H ₄ -4-F	0	2-F	
1.213	C ₆ H ₄ -4-F	0	3-F	
1.214	C ₆ H ₄ -4-F	0	4-F	
1.215	C ₆ H ₄ -4-F	0	2-Cl	
1.216	C ₆ H ₄ -4-F	0	3-Cl	
1.217	C ₆ H ₄ -4-F	0	4-Cl	
1.218	C ₆ H ₄ -4-F	0	2,3-Cl ₂	
1.219	C ₆ H ₄ -4-F	0	2,4-Cl ₂	
1.220	C ₆ H ₄ -4-F	0	2,5-Cl ₂	
1.221	C ₆ H ₄ -4-F	0	2,6-Cl ₂	
1.222	C ₆ H ₄ -4-F	0	3,4-Cl ₂	
1.223	C ₆ H ₄ -4-F	0	3,5-Cl ₂	
1.224	C ₆ H ₄ -4-F	0	3-CF ₃	
1.225	C ₆ H ₄ -4-F	0	4-CF ₃	
1.226	C ₆ H ₄ -4-F	1	H	

No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.227	C ₆ H ₄ -4-F	1	2-F	
1.228	C ₆ H ₄ -4-F	1	3-F	
1.229	C ₆ H ₄ -4-F	1	4-F	
1.230	C ₆ H ₄ -4-F	1	2-Cl	
1.231	C ₆ H ₄ -4-F	1	3-Cl	
1.232	C ₆ H ₄ -4-F	1	4-Cl	
1.233	C ₆ H ₄ -4-F	1	2,3-Cl ₂	
1.234	C ₆ H ₄ -4-F	1	2,4-Cl ₂	
1.235	C ₆ H ₄ -4-F	1	2,5-Cl ₂	
1.236	C ₆ H ₄ -4-F	1	2,6-Cl ₂	
1.237	C ₆ H ₄ -4-F	1	3,4-Cl ₂	
1.238	C ₆ H ₄ -4-F	1	3,5-Cl ₂	
1.239	C ₆ H ₄ -4-F	1	3-CF ₃	
1.240	C ₆ H ₄ -4-F	1	4-CF ₃	
1.241	C ₆ H ₄ -4-Cl	0	H	
1.242	C ₆ H ₄ -4-Cl	0	2-F	
1.243	C ₆ H ₄ -4-Cl	0	3-F	
1.244	C ₆ H ₄ -4-Cl	0	4-F	
1.245	C ₆ H ₄ -4-Cl	0	2-Cl	
1.246	C ₆ H ₄ -4-Cl	0	3-Cl	
1.247	C ₅ H ₄ -4-Cl	0	4-Cl	
1.248	C ₆ H ₄ -4-Cl	0	2,3-Cl ₂	
1.249	C ₆ H ₄ -4-Cl	0	2,4-Cl ₂	
1.250	C ₆ H ₄ -4-Cl	0	2,5-Cl ₂	
1.251	C ₆ H ₄ -4-Cl	0	2,6-Cl ₂	
1.252	C ₆ H ₄ -4-Cl	0	3,4-Cl ₂	
1.253	C ₆ H ₄ -4-Cl	0	3,5-Cl ₂	
1.254	C ₆ H ₄ -4-Cl	0	3-CF ₃	
1.255	C ₆ H ₄ -4-Cl	0	4-CF ₃	
1.256	C ₆ H ₄ -4-Cl	1	H	
1.257	C ₆ H ₄ -4-Cl	1	2-F	
1.258	C ₆ H ₄ -4-Cl	1	3-F	

No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.259	C ₆ H ₄ -4-Cl	1	4-F	
1.260	C ₆ H ₄ -4-Cl	1	2-Cl	
1.261	C ₆ H ₄ -4-Cl	1	3-Cl	
1.262	C ₆ H ₄ -4-Cl	1	4-Cl	
1.263	C ₆ H ₄ -4-Cl	1	2,3-Cl ₂	
1.264	C ₆ H ₄ -4-Cl	1	2,4-Cl ₂	
1.265	C ₆ H ₄ -4-Cl	1	2,5-Cl ₂	
1.266	C ₆ H ₄ -4-Cl	1	2,6-Cl ₂	
1.267	C ₆ H ₄ -4-Cl	1	3,4-Cl ₂	
1.268	C ₆ H ₄ -4-Cl	1	3,5-Cl ₂	
1.269	C ₆ H ₄ -4-Cl	1	3-CF ₃	
1.270	C ₆ H ₄ -4-Cl	1	4-CF ₃	
1.271	C ₆ H ₄ -4-Br	0	H	
1.272	C ₆ H ₄ -4-Br	0	2-F	
1.273	C ₆ H ₄ -4-Br	0	3-F	
1.274	C ₆ H ₄ -4-Br	0	4-F	
1.275	C ₆ H ₄ -4-Br	0	2-Cl	
1.276	C ₆ H ₄ -4-Br	0	3-Cl	
1.277	C ₆ H ₄ -4-Br	0	4-Cl	
1.278	C ₆ H ₄ -4-Br	0	2,3-Cl ₂	
1.279	C ₆ H ₄ -4-Br	0	2,4-Cl ₂	
1.280	C ₆ H ₄ -4-Br	0	2,5-Cl ₂	
1.281	C ₆ H ₄ -4-Br	0	2,6-Cl ₂	
1.282	C ₆ H ₄ -4-Br	0	3,4-Cl ₂	
1.283	C ₆ H ₄ -4-Br	0	3,5-Cl ₂	
1.284	C ₆ H ₄ -4-Br	0	3-CF ₃	
1.285	C ₆ H ₄ -4-Br	0	4-CF ₃	
1.286	C ₆ H ₄ -4-Br	1	H	
1.287	C ₆ H ₄ -4-Br	1	2-F	
1.288	C ₆ H ₄ -4-Br	1	3-F	
1.289	C ₆ H ₄ -4-Br	1	4-F	
1.290	C ₆ H ₄ -4-Br	1	2-Cl	

No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.291	C ₆ H ₄ -4-Br	1	3-Cl	
1.292	C ₆ H ₄ -4-Br	1	4-Cl	
1.293	C ₆ H ₄ -4-Br	1	2,3-Cl ₂	
1.294	C ₆ H ₄ -4-Br	1	2,4-Cl ₂	
1.295	C ₆ H ₄ -4-Br	1	2,5-Cl ₂	
1.296	C ₆ H ₄ -4-Br	1	2,6-Cl ₂	
1.297	C ₆ H ₄ -4-Br	1	3,4-Cl ₂	
1.298	C ₆ H ₄ -4-Br	1	3,5-Cl ₂	
1.299	C ₆ H ₄ -4-Br	1	3-CF ₃	
1.300	C ₆ H ₄ -4-Br	1	4-CF ₃	
1.301	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	0	H	
1.302	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	0	2-F	
1.303	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	0	3-F	
1.304	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	0	4-F	
1.305	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	0	2-Cl	
1.306	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	0	3-Cl	
1.307	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	0	4-Cl	
1.308	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	0	2,3-Cl ₂	
1.309	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	0	2,4-Cl ₂	
1.310	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	0	2,5-Cl ₂	
1.311	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	0	2,6-Cl ₂	
1.312	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	0	3,4-Cl ₂	
1.313	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	0	3,5-Cl ₂	
1.314	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	0	3-CF ₃	
1.315	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	0	4-CF ₃	
1.316	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	1	H	
1.317	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	1	2-F	
1.318	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	1	3-F	
1.319	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	1	4-F	
1.320	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	1	2-Cl	
1.321	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	1	3-Cl	
1.322	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	1	4-Cl	

No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.323	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	1	2,3-Cl ₂	
1.324	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	1	2,4-Cl ₂	
1.325	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	1	2,5-Cl ₂	
1.326	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	1	2,6-Cl ₂	
1.327	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	1	3,4-Cl ₂	
1.328	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	1	3,5-Cl ₂	
1.329	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	1	3-CF ₃	
1.330	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	1	4-CF ₃	
1.331	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	0	H	
1.332	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	0	2-F	
1.333	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	0	3-F	
1.334	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	0	4-F	
1.335	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	0	2-Cl	
1.336	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	0	3-Cl	
1.337	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	0	4-Cl	
1.338	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	0	2,3-Cl ₂	
1.339	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	0	2,4-Cl ₂	
1.340	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	0	2,5-Cl ₂	
1.341	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	0	2,6-Cl ₂	
1.342	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	0	3,4-Cl ₂	
1.343	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	0	3,5-Cl ₂	
1.344	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	0	3-CF ₃	
1.345	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	0	4-CF ₃	
1.346	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	1	H	
1.347	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	1	2-F	
1.348	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	1	3-F	
1.349	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	1	4-F	
1.350	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	1	2-Cl	
1.351	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	1	3-Cl	
1.352	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	1	4-Cl	
1.353	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	1	2,3-Cl ₂	
1.354	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	1	2,4-Cl ₂	

No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.355	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	1	2,5-Cl ₂	
1.356	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	1	2,6-Cl ₂	
1.357	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	1	3,4-Cl ₂	
1.358	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	1	3,5-Cl ₂	
1.359	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	1	3-CF ₃	
1.360	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	1	4-CF ₃	
1.361	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	0	H	
1.362	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	0	2-F	
1.363	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	0	3-F	
1.364	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	0	4-F	
1.365	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	0	2-Cl	
1.366	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	0	3-Cl	
1.367	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	0	4-Cl	
1.368	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	0	2,3-Cl ₂	
1.369	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	0	2,4-Cl ₂	
1.370	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	0	2,5-Cl ₂	
1.371	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	0	2,6-Cl ₂	
1.372	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	0	3,4-Cl ₂	
1.373	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	0	3,5-Cl ₂	
1.374	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	0	3-CF ₃	
1.375	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	0	4-CF ₃	
1.376	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	1	H	
1.377	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	1	2-F	
1.378	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	1	3-F	
1.379	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	1	4-F	
1.380	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	1	2-Cl	
1.381	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	1	3-Cl	
1.382	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	1	4-Cl	
1.383	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	1	2,3-Cl ₂	
1.384	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	1	2,4-Cl ₂	
1.385	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	1	2,5-Cl ₂	
1.386	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	1	2,6-Cl ₂	

No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.387	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	1	3,4-Cl ₂	
1.388	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	1	3,5-Cl ₂	
1.389	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	1	3-CF ₃	
1.390	C ₆ H ₄ -3-CF ₃	1	4-CF ₃	
1.391	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	0	H	
1.392	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	0	2-F	
1.393	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	0	3-F	
1.394	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	0	4-F	
1.395	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	0	2-Cl	
1.396	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	0	3-Cl	
1.397	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	0	4-Cl	
1.398	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	0	2,3-Cl ₂	
1.399	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	0	2,4-Cl ₂	
1.400	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	0	2,5-Cl ₂	
1.401	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	0	2,6-Cl ₂	
1.402	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	0	3,4-Cl ₂	
1.403	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	0	3,5-Cl ₂	
1.404	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	0	3-CF ₃	
1.405	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	0	4-CF ₃	
1.406	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	1	H	
1.407	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	1	2-F	
1.408	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	1	3-F	
1.409	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	1	4-F	
1.410	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	1	2-Cl	
1.411	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	1	3-Cl	
1.412	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	1	4-Cl	
1.413	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	1	2,3-Cl ₂	
1.414	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	1	2,4-Cl ₂	
1.415	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	1	2,5-Cl ₂	
1.416	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	1	2,6-Cl ₂	
1.417	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	1	3,4-Cl ₂	
1.418	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	1	3,5-Cl ₂	

No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.419	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	1	3-CF ₃	
1.420	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	1	4-CF ₃	
1.421	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	0	H	
1.422	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	0	2-F	
1.423	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	0	3-F	
1.424	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	0	4-F	
1.425	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	0	2-Cl	
1.426	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	0	3-Cl	
1.427	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	0	4-Cl	
1.428	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	0	2,3-Cl ₂	
1.429	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	0	2,4-Cl ₂	
1.430	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	0	2,5-Cl ₂	
1.431	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	0	2,6-Cl ₂	
1.432	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	0	3,4-Cl ₂	
1.433	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	0	3,5-Cl ₂	
1.434	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	0	3-CF ₃	
1.435	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	0	4-CF ₃	
1.436	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	1	H	
1.437	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	1	2-F	
1.438	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	1	3-F	
1.439	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	1	4-F	
1.440	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	1	2-Cl	
1.441	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	1	3-Cl	
1.442	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	1	4-Cl	
1.443	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	1	2,3-Cl ₂	
1.444	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	1	2,4-Cl ₂	
1.445	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	1	2,5-Cl ₂	
1.446	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	1	2,6-Cl ₂	
1.447	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	1	3,4-Cl ₂	
1.448	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	1	3,5-Cl ₂	
1.449	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	1	3-CF ₃	
1.450	C ₆ H ₄ -3-NO ₂	1	4-CF ₃	

No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.451	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	0	H	
1.452	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	0	2-F	
1.453	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	0	3-F	
1.454	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	0	4-F	
1.455	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	0	2-Cl	
1.456	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	0	3-Cl	
1.457	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	0	4-Cl	
1.458	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	0	2,3-Cl ₂	
1.459	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	0	2,4-Cl ₂	
1.460	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	0	2,5-Cl ₂	
1.461	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	0	2,6-Cl ₂	
1.462	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	0	3,4-Cl ₂	
1.463	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	0	3,5-Cl ₂	
1.464	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	0	3-CF ₃	
1.465	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	0	4-CF ₃	
1.466	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	1	H	
1.467	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	1	2-F	
1.468	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	1	3-F	
1.469	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	1	4-F	
1.470	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	1	2-Cl	
1.471	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	1	3-Cl	
1.472	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	1	4-Cl	
1.473	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	1	2,3-Cl ₂	
1.474	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	1	2,4-Cl ₂	
1.475	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	1	2,5-Cl ₂	
1.476	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	1	2,6-Cl ₂	
1.477	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	1	3,4-Cl ₂	
1.478	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	1	3,5-Cl ₂	
1.479	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	1	3-CF ₃	
1.480	C ₆ H ₂ -2,3,4-Cl ₃	1	4-CF ₃	
1.481	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	0	H	
1.482	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	0	2-F	

No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.483	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	0	3-F	
1.484	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	0	4-F	
1.485	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	0	2-Cl	
1.486	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	0	3-Cl	
1.487	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	0	4-Cl	
1.488	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	0	2,3-Cl ₂	
1.489	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	0	2,4-Cl ₂	
1.490	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	0	2,5-Cl ₂	
1.491	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	0	2,6-Cl ₂	
1.492	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	0	3,4-Cl ₂	
1.493	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	0	3,5-Cl ₂	
1.494	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	0	3-CF ₃	
1.495	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	0	4-CF ₃	
1.496	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	1	H	
1.497	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	1	2-F	
1.498	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	1	3-F	
1.499	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	1	4-F	
1.500	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	1	2-Cl	
1.501	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	1	3-Cl	
1.502	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	1	4-Cl	
1.503	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	1	2,3-Cl ₂	
1.504	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	1	2,4-Cl ₂	
1.505	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	1	2,5-Cl ₂	
1.506	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	1	2,6-Cl ₂	
1.507	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	1	3,4-Cl ₂	
1.508	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	1	3,5-Cl ₂	
1.509	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	1	3-CF ₃	
1.510	C ₆ H ₂ -2,4,5-Cl ₃	1	4-CF ₃	
1.511	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	0	H	
1.512	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	0	2-F	
1.513	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	0	3-F	
1.514	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	0	4-F	

No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.515	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	0	2-Cl	
1.516	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	0	3-Cl	
1.517	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	0	4-Cl	
1.518	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	0	2,3-Cl ₂	
1.519	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	0	2,4-Cl ₂	
1.520	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	0	2,5-Cl ₂	
1.521	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	0	2,6-Cl ₂	
1.522	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	0	3,4-Cl ₂	
1.523	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	0	3,5-Cl ₂	
1.524	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	0	3-CF ₃	
1.525	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	0	4-CF ₃	
1.526	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	1	H	
1.527	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	1	2-F	
1.528	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	1	3-F	
1.529	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	1	4-F	
1.530	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	1	2-Cl	
1.531	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	1	3-Cl	
1.532	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	1	4-Cl	
1.533	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	1	2,3-Cl ₂	
1.534	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	1	2,4-Cl ₂	
1.535	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	1	2,5-Cl ₂	
1.536	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	1	2,6-Cl ₂	
1.537	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	1	3,4-Cl ₂	
1.538	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	1	3,5-Cl ₂	
1.539	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	1	3-CF ₃	
1.540	C ₆ H ₃ -2-OCH ₃ -5-Br	1	4-CF ₃	
1.541	1-萘基	0	H	
1.542	1-萘基	0	2-F	
1.543	1-萘基	0	3-F	
1.544	1-萘基	0	4-F	
1.545	1-萘基	0	2-Cl	
1.546	1-萘基	0	3-Cl	

No.	R ₂	n	(Y)	物理数据
1.547	1-萘基	0	4-Cl	
1.548	1-萘基	0	2,3-Cl ₂	
1.549	1-萘基	0	2,4-Cl ₂	
1.550	1-萘基	0	2,5-Cl ₂	
1.551	1-萘基	0	2,6-Cl ₂	
1.552	1-萘基	0	3,4-Cl ₂	
1.553	1-萘基	0	3,5-Cl ₂	
1.554	1-萘基	0	3-CF ₃	
1.555	1-萘基	0	4-CF ₃	
1.556	1-萘基	1	H	
1.557	1-萘基	1	2-F	
1.558	1-萘基	1	3-F	
1.559	1-萘基	1	4-F	
1.560	1-萘基	1	2-Cl	
1.561	1-萘基	1	3-Cl	
1.562	1-萘基	1	4-Cl	
1.563	1-萘基	1	2,3-Cl ₂	
1.564	1-萘基	1	2,4-Cl ₂	
1.565	1-萘基	1	2,5-Cl ₂	
1.566	1-萘基	1	2,6-Cl ₂	
1.567	1-萘基	1	3,4-Cl ₂	
1.568	1-萘基	1	3,5-Cl ₂	
1.569	1-萘基	1	3-CF ₃	
1.570	1-萘基	1	4-CF ₃	

生物学实施例

A. 对动物寄生虫的防治

实施例 B.1. 在蒙古长爪沙鼠(长爪沙鼠属(Meriones unguiculatus))中经口服给药后对抗蛇形毛圆线虫(Trichostrongylus colubriformis)和捻转血矛线虫(Haemonchus contortus)的体内试验

通过人工喂养各约 2000 只蛇形毛圆线虫和捻转血矛线虫的三龄幼虫使六至八周龄的蒙古长爪沙鼠感染。感染 6 天后, 将沙鼠用 N₂O 浅度麻醉, 口服施用溶于 2 份 DMSO 与 1 份聚乙二醇(PEG 300)的混合物中的测试化合物进行处理, 剂量为 100、32 和 10-0.1 mg/kg。在第 9 天(处理后 3 天), 当大多数捻转血矛线虫为晚期四龄幼虫和大多数蛇形毛圆线虫为未成熟成虫时, 将沙鼠处死, 计算线虫数量。功效以与 8 只感染且未经处理的沙鼠中线虫数量的几何平均数相比、每只沙鼠中线虫数量减少的%计算。

在该试验中, 使用式(I)化合物获得线虫攻击的大幅度降低。

B.对植物害虫的防治

实施例 B.2: 抗烟芽夜蛾(Heliothis virescens)幼虫的活性

对大豆幼苗喷洒含 400 ppm 活性成分的含水乳液喷雾混合物, 待喷雾表层干燥后, 放上 10 只烟芽夜蛾一龄幼虫, 然后置于塑料容器中。6 天后进行评价。通过比较经处理的植物和未经处理的植物上死亡幼虫的数量和取食损伤(feeding damage)来测定幼虫数量和取食损失减少的百分数(%活性)。

在该试验中, 表中的化合物表现出良好的抗烟芽夜蛾活性。

实施例 B.3: 抗菜蛾(Plutella xylostella)幼虫的活性

对卷心菜幼苗喷洒含 400 ppm 活性成分的含水乳液喷雾混合物, 待喷雾表层干燥后, 放上 10 只小菜蛾 3 龄幼虫, 然后置于塑料容器中。3 天后进行评价。通过比较经处理的植物和未经处理的植物上死亡幼虫的数量和取食损伤来测定幼虫数量和取食损失减少的百分数(%活性)。

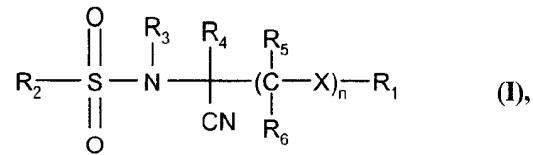
在该试验中，表中的化合物表现出良好的抗菜蛾活性。

实施例 B.4: 抗待斑黄瓜叶甲(*Diabrotica balteata*)幼虫的活性

对玉米秧苗喷洒含 400 ppm 活性成分的含水乳液喷雾混合物，待喷雾表层干燥后，放上 10 只待斑黄瓜叶甲 2 龄幼虫，然后置于塑料容器中。6 天后进行评价。通过比较经处理的植物和未经处理的植物上死亡幼虫的数量来测定幼虫数量减少的百分数(%活性)。

在该试验中，表中的化合物表现出良好的抗待斑黄瓜叶甲活性。

1. 式(I)化合物、以及如果恰当的话其E/Z异构体、E/Z异构体混合物和/或互变异构体, 在每种情况下为游离形式或盐形式:



其中:

R_1 为芳基或杂芳基, 在每种情况下是未取代的或者被 R_7 单取代或多取代, 其中如果取代基的数目大于1, 则它们在每种情况下可以相同或不同;

R_2 为 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_8 环烷基、卤代- C_3 - C_8 环烷基、 NHR_8 ; 芳基或杂芳基, 在每种情况下是未取代的或者被 R_7 单取代或多取代, 其中如果取代基的数目大于1, 则它们在每种情况下可以相同或不同, 或者为吡咯烷基、哌啶子基、咪唑烷基、哌嗪基、吡唑烷基、吗啉基、二氢吲哚基或异二氢吲哚基, 在每种情况下通过N键合;

R_3 为氢、 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基- C_1 - C_6 烷基、苄基、 C_1 - C_6 烷基-杂芳基、 C_1 - C_6 烷氧羰基或 C_1 - C_6 烷基羰基;

R_4 、 R_5 和 R_6 彼此独立地为氢、卤素、 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、卤代- C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、卤代- C_1 - C_6 烷硫基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 炔基、未取代或被选自卤素和 C_1 - C_6 烷基的取代基取代的 C_3 - C_8 环烷基, 或者未取代或被选自卤素、 C_1 - C_6 烷基和苯基的取代基取代的苯基;

或者 R_4 和 R_5 与它们键合的碳原子一起为具有1或2个选自氮、氧和硫的杂原子的五元至七元的饱和或部分不饱和杂环;

R_7 为卤素、 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、卤代- C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、卤代- C_1 - C_6 烷硫基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 炔基; 芳基、苄基乙炔基或杂芳基, 在每种情况下是未取代的或者单或多取代的, 其中取代基在每种情况下选自卤素、硝基、氰基、 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、卤代- C_1 - C_6 烷氧基, 并且如果取代基的数目大于1,

则它们在每种情况下可以相同或不同;

R_8 为未取代或单至五取代的芳基,其中取代基选自卤素、硝基、氰基、 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基和卤代- C_1 - C_6 烷氧基,并且如果取代基的数目大于1,则它们可以相同或不同;

X为O、S、S(O)或S(O)₂; 以及

n为1。

2. 根据权利要求1的式(I)化合物,其中 R_1 为未取代的或者被 R_7 单至五取代的芳基,其中如果取代基的数目大于1,则它们在每种情况下可以相同或不同。

3. 根据权利要求1的式(I)化合物,其中 R_1 为被 R_7 单至三取代的芳基,其中如果取代基的数目大于1,则它们在每种情况下可以相同或不同。

4. 根据权利要求1的式(I)化合物,其中 R_2 为 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、在每种情况下为未取代或被 R_7 单至多取代的芳基或杂芳基,其中如果取代基的数目大于1,则它们在每种情况下可以相同或不同。

5. 根据权利要求1的式(I)化合物,其中 R_2 为 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基或未取代或被 R_7 单至五取代的芳基,其中如果取代基的数目大于1,则它们可以相同或不同。

6. 根据权利要求1的式(I)化合物,其中 R_2 为未取代或被 R_7 单至三取代的芳基,其中如果取代基的数目大于1,则它们可以相同或不同。

7. 根据权利要求1的式(I)化合物,其中 R_3 为氢或 C_1 - C_6 烷基。

8. 根据权利要求1的式(I)化合物,其中 R_3 为氢或 C_1 - C_4 烷基。

9. 根据权利要求1的式(I)化合物,其中 R_3 为氢。

10. 根据权利要求1的式(I)化合物,其中 R_4 、 R_5 和 R_6 彼此独立地为氢、 C_1 - C_6 烷基、卤代- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、卤代- C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_3 - C_6 环烷基。

11. 根据权利要求1的式(I)化合物,其中 R_4 、 R_5 和 R_6 彼此独立地为氢、 C_1 - C_4 烷基、卤代- C_1 - C_4 烷基或 C_3 - C_6 环烷基。

12. 根据权利要求1的式(I)化合物,其中 R_4 、 R_5 和 R_6 彼此独立地为氢或

C₁-C₂烷基。

13. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中R₇为卤素、C₁-C₄烷基、卤代-C₁-C₄烷基、C₁-C₄-烷氧基、卤代-C₁-C₄烷氧基; 在每种情况下为未取代或单或多取代的芳基或苯基乙炔基, 其中取代基选自卤素、C₁-C₆烷基、卤代-C₁-C₆烷基、C₁-C₆烷氧基、卤代-C₁-C₆烷氧基, 且如果取代基的数目大于1, 则它们在每种情况下可以相同或不同。

14. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中R₇为卤素、C₁-C₂烷基、卤代-C₁-C₂烷基、C₁-C₂烷氧基、卤代-C₁-C₂烷氧基。

15. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中R₇为卤素或卤代-C₁-C₂烷基。

16. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中R₈为未取代或单至三取代的芳基, 其中取代基选自卤素、C₁-C₄烷基、卤代-C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基和卤代-C₁-C₄烷氧基, 且如果取代基的数目大于1, 则它们可以相同或不同。

17. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中R₈为单至三取代的芳基, 其中取代基选自卤素、C₁-C₂烷基、卤代-C₁-C₂烷基和卤代-C₁-C₂烷氧基, 且如果取代基的数目大于1, 则它们可以相同或不同。

18. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中R₈为单或二取代的芳基, 其中取代基选自卤素和卤代-C₁-C₂烷基, 且如果取代基的数目大于1, 则它们可以相同或不同。

19. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中X为O或S。

20. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中X为O。

22. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中R₁为未取代或被R₇单或五取代的芳基, 其中如果取代基的数目大于1, 则它们在每种情况下可以相同或不同; R₂为C₁-C₆烷基、卤代-C₁-C₆烷基, 在每种情况下是未取代或被R₇单或多取代的芳基或杂芳基, 其中如果取代基的数目大于1, 则它们在每种情况下可以相同或不同; R₃为氢或C₁-C₆烷基; R₄、R₅和R₆彼此独立地为氢、C₁-C₆烷基、卤代-C₁-C₆烷基、C₁-C₆烷氧基、卤代-C₁-C₆烷氧基、C₂-C₆链烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₆环烷基; R₇为卤素、C₁-C₄烷基、卤代-C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基、卤代-C₁-C₄烷氧基、在每种情况下为未取代或单或多取代的

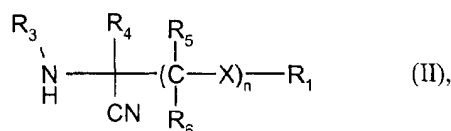
芳基或苯基乙炔基, 其中取代基选自卤素、C₁-C₆烷基、卤代-C₁-C₆烷基、C₁-C₆烷氧基、卤代-C₁-C₆烷氧基, 且如果取代基的数目大于1, 则它们在每种情况下可以相同或不同; R₈为未取代或单至三取代的芳基, 其中取代基选自卤素、C₁-C₄烷基、卤代-C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基和卤代-C₁-C₄烷氧基, 且如果取代基的数目大于1, 则它们可以相同或不同; 且X为O或S。

23. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中R₁为被R₇单或三取代的芳基, 其中如果取代基的数目大于1, 则它们在每种情况下可以相同或不同; R₂为C₁-C₆烷基、卤代-C₁-C₆烷基或未取代或被R₇单至五取代的芳基, 其中如果取代基的数目大于1, 则它们可以相同或不同; R₃为氢或C₁-C₄烷基; R₄、R₅和R₆彼此独立地为氢、C₁-C₄烷基、卤代-C₁-C₄烷基或C₃-C₆环烷基; R₇为卤素、C₁-C₂烷基、卤代-C₁-C₂烷基、C₁-C₂烷氧基或卤代-C₁-C₂烷氧基; R₈为单至三取代的芳基, 其中取代基选自卤素、C₁-C₂烷基、卤代-C₁-C₂烷基和卤代-C₁-C₂烷氧基, 且如果取代基的数目大于1, 则它们可以相同或不同; 且X为O。

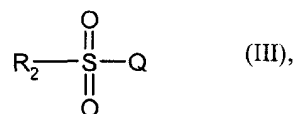
24. 根据权利要求1的式(I)化合物, 其中R₁为被R₇单至三取代的芳基, 其中如果取代基的数目大于1, 则它们在每种情况下可以相同或不同; R₂为未取代或被R₇单至三取代的芳基, 其中如果取代基的数目大于1, 则它们在每种情况下可以相同或不同; R₃为氢; R₄、R₅和R₆彼此独立地为氢或C₁-C₂烷基; R₇为卤素或卤代-C₁-C₂烷基; R₈为单或二取代的芳基, 其中取代基选自卤素和卤代-C₁-C₂烷基, 且如果取代基的数目大于1, 则它们可以相同或不同; 且X为O。

25. 根据权利要求1的式(I)化合物, 命名为N-(1-氰基-1-[2,3-二氯苯氧甲基]乙基)-C-苯基甲磺酰胺。

26. 制备根据权利要求1的在每种情况下为游离形式或盐形式的式(I)化合物的方法, 其特征在于使已知或可类似于相应已知化合物制备的式(II)化合物



其中R₁、R₃、R₄、R₅、R₆、X和n如式(I)中定义，
与已知或可类似于相应已知化合物制备的式(III)化合物反应，



其中R₂如式(I)中定义且Q为离去基团，如果合适的话在碱性催化剂存在下反应，并且在每种情况下如果需要，将根据该方法或另一种方法可得到的、在每种情况下为游离形式或盐形式的式(I)化合物转化为另一种式(I)化合物，将根据该方法可得到的异构体混合物分离并分离出需要的异构体和/或将根据该方法可得到的游离式(I)化合物转化为盐，或者将根据该方法可得到的式(I)化合物的盐转化为游离式(I)化合物或另一种盐。

27. 用于防治寄生虫的组合物，其除了载体和/或分散剂外，还含有至少一种根据权利要求1的式(I)化合物作为活性化合物。

28. 根据权利要求1的式(I)化合物用于防治寄生虫的用途。

29. 防治寄生虫的方法，其特征在于使用有效量的至少一种根据权利要求1的式(I)化合物对抗寄生虫。

30. 根据权利要求1的式(I)化合物在防治温血动物中寄生虫的方法中的用途。

31. 根据权利要求1的式(I)化合物在制备对抗温血动物中寄生虫的药物组合物中的用途。