



(12)发明专利

(10)授权公告号 CN 106231905 B

(45)授权公告日 2019.04.09

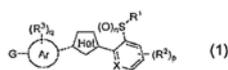
(21)申请号 201580020759.9
 (22)申请日 2015.04.21
 (65)同一申请的已公布的文献号
 申请公布号 CN 106231905 A
 (43)申请公布日 2016.12.14
 (30)优先权数据
 2014-089864 2014.04.24 JP
 (85)PCT国际申请进入国家阶段日
 2016.10.20
 (86)PCT国际申请的申请数据
 PCT/JP2015/062627 2015.04.21
 (87)PCT国际申请的公布数据
 W02015/163478 JA 2015.10.29
 (73)专利权人 住友化学株式会社
 地址 日本国东京都
 (72)发明人 折本浩平 水野肇 野仓吉彦
 中岛祐二
 (74)专利代理机构 中科专利商标代理有限责任
 公司 11021
 代理人 葛凡

C07D 413/14(2006.01)
 C07D 417/04(2006.01)
 C07D 417/14(2006.01)
 A01N 43/824(2006.01)
 A01N 43/836(2006.01)
 A01P 7/02(2006.01)
 A01P 7/04(2006.01)
 (56)对比文件
 CN 1079221 A,1993.12.08,
 JP 特开平5-1060 A,1993.01.08,
 US 6413992 B1,2002.07.02,
 JP 平2-304069 A,1990.12.17,
 US 2009163545 A1,2009.06.25,
 JP 特开2008-308495 A,2008.12.25,
 CN 102159079 A,2011.08.17,
 CN 1250049 A,2000.04.12,
 US 4414221 A,1983.11.08,
 US 4215129 A,1980.07.29,
 刘玉婷等.2,5-二取代-1,3,4-噻二唑类化
 合物的合成及应用研究.《精细化工中间体》
 .2009,第39卷(第1期),
 审查员 甘雨

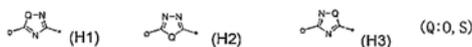
(51) Int. Cl.
 C07D 413/04(2006.01)

权利要求书2页 说明书71页

(54)发明名称
 二芳基-噻化合物

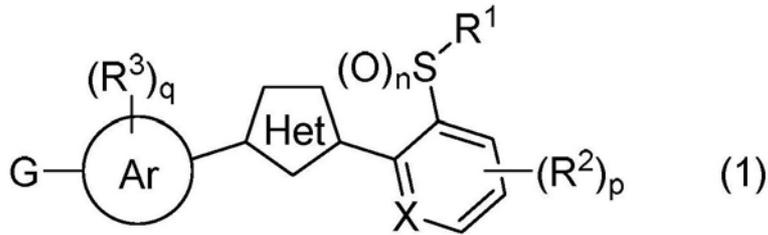


(57)摘要
 本发明提供对有害节肢动物具有优异的防除效力的式(1)所示的二芳基-噻化合物、对有害节肢动物具有优异的防除效力的防除剂、和使用该防除剂的有害节肢动物的防除方法。 R^{1-3} :
 C₁₋₆链式烃等;p:0-3;q:0-4;n:0-2;X:N、CH等;
 Ar:苯基、5-6元芳香族杂环;G:C₁₋₆链式烃等;
 Het:式(H1)(H2)(H3)。



CN 106231905 B

1. 一种式 (1) 所示的二芳基-噻化合物,



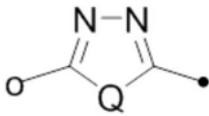
式中,

X表示氮原子,

R¹表示乙基,

R²、R³和G独立地表示三氟甲基或者卤素原子,

Het表示下式H2:



(H2)

式中,Q表示氧原子或硫原子,

Ar表示苯基或者吡啶基,

n表示0、1或2,

p表示0,

q表示0或1。

2. 如权利要求1所述的二芳基-噻化合物,其中,

R²、R³和G独立地表示三氟甲基或者氯原子。

3. 如权利要求1或2所述的二芳基-噻化合物,其为化合物1-1、化合物1-2、化合物1-3、化合物1-4、化合物1-5、化合物1-25、化合物1-39、化合物1-40或者化合物1-43,

所述化合物1-1是:X为氮原子、p为0、R¹为乙基、n为0、Het为H2-0、(R³)_qGAr-为5-(三氟甲基)吡啶-2-基的式(1)所示的二芳基-噻化合物;

所述化合物1-2是:X为氮原子、p为0、R¹为乙基、n为1、Het为H2-0、(R³)_qGAr-为5-(三氟甲基)吡啶-2-基的式(1)所示的二芳基-噻化合物;

所述化合物1-3是:X为氮原子、p为0、R¹为乙基、n为2、Het为H2-0、(R³)_qGAr-为5-(三氟甲基)吡啶-2-基的式(1)所示的二芳基-噻化合物;

所述化合物1-4是:X为氮原子、p为0、R¹为乙基、n为1、Het为H2-S、(R³)_qGAr-为5-(三氟甲基)吡啶-2-基的式(1)所示的二芳基-噻化合物;

所述化合物1-5是:X为氮原子、p为0、R¹为乙基、n为2、Het为H2-S、(R³)_qGAr-为5-(三氟甲基)吡啶-2-基的式(1)所示的二芳基-噻化合物;

所述化合物1-25是:X为氮原子、p为0、R¹为乙基、n为2、Het为H2-0、(R³)_qGAr-为3,5-双(三氟甲基)苯基的式(1)所示的二芳基-噻化合物;

所述化合物1-39是:X为氮原子、p为0、R¹为乙基、n为2、Het为H2-S、(R³)_qGAr-为3,5-双(三氟甲基)苯基的式(1)所示的二芳基-噻化合物;

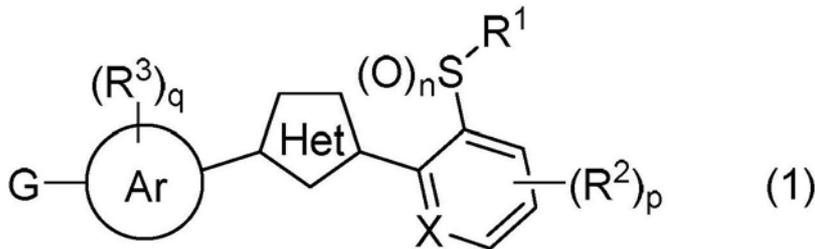
所述化合物1-40是：X为氮原子、p为0、R¹为乙基、n为0、Het为H2-S、(R³)_qAr-为5-(三氟甲基)吡啶-2-基的式(1)所示的二芳基-噻化合物；

所述化合物1-43是：X为氮原子、p为0、R¹为乙基、n为2、Het为H2-S、(R³)_qAr-为3-氯-5-(三氟甲基)苯基的式(1)所示的二芳基-噻化合物。

4. 如权利要求1或2所述的二芳基-噻化合物，其中，Q为氧原子。

5. 如权利要求1或2所述的二芳基-噻化合物，其中，Q为硫原子。

6. 一种有害节肢动物防除方法，其将式(1)所示的二芳基-噻化合物的有效量向有害节肢动物或有害节肢动物的栖息场所施用，该防除方法为非治疗目的的方法，

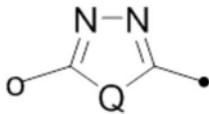


式中，

X表示氮原子，

R¹表示乙基，

R²和R³和G独立地表示三氟甲基或者卤素原子，Het表示下式H2：



(H2)

式中，Q表示氧原子或硫原子，

Ar表示苯基或者吡啶基，

n表示0、1或2，

p表示0，

q表示0或1。

二芳基-噻化合物

技术领域

[0001] 本发明涉及某种二芳基-噻化合物及其有害节肢动物防除用途。

背景技术

[0002] 至今,以有害节肢动物的防除为目的,已研究了各种化合物供于实用。

[0003] 另外,已知某种二芳基-噻化合物(例如参照专利文献1)。

[0004] [现有技术文献]

[0005] [专利文献]

[0006] [专利文献1]日本特开2000-318312号公报

发明内容

[0007] 发明要解决的课题

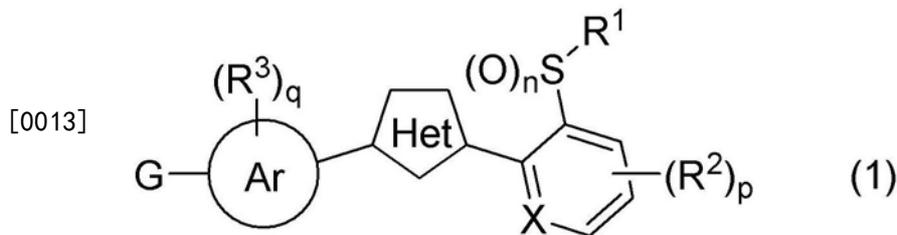
[0008] 本发明的课题在于提供对有害节肢动物具有优异的防除效力的化合物、对有害节肢动物具有优异的防除效力的防除剂及使用了该防除剂的有害节肢动物的防除方法。

[0009] 解决课题的方法

[0010] 本发明人等为了解决上述课题进行了深入研究,结果发现下述式(1)所示的二芳基-噻化合物对有害节肢动物具有优异的防除效力,从而得到了本发明。

[0011] 本发明如下所述。

[0012] [1]含有式(1)所示的二芳基-噻化合物或其N-氧化物(以下,将式(1)所示的二芳基-噻化合物及其N-氧化物记作本化合物)和惰性载体的有害节肢动物防除剂(以下,记作本发明防除剂),



[0014] [式中,

[0015] X表示氮原子或CR⁴,

[0016] R¹表示可具有选自组α中的1个以上原子或基团的C1-C6链式烃基、或者可具有选自组β中的1个以上原子或基团的C3-C9脂环式烃基,

[0017] R²和R³独立地表示可具有选自组α中的1个以上原子或基团的C1-C6链式烃基、可具有选自组β中的1个以上原子或基团的C3-C9脂环式烃基、可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的苯基、可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的5或6元杂环基、C(O)R⁵、C(O)OR⁵、C(O)NR⁵R⁶、OR⁵、SR⁵、S(O)₁R^{5x}、S(O)₂NR⁵R⁶、NR⁵R⁶、NR⁵C(O)R⁶、NR⁵C(O)OR⁶、硝基、氰基或者卤素原子,

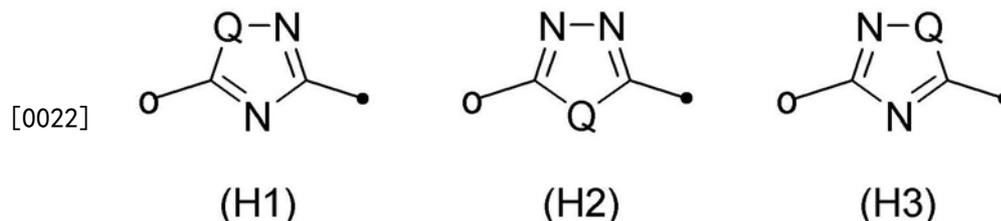
[0018] R⁴表示可具有选自组α中的1个以上原子或基团的C1-C6链式烃基、可具有选自组β

中的1个以上原子或基团的C3-C9脂环式烃基、可具有选自组 γ 中的1个以上原子或基团的苯基、可具有选自组 γ 中的1个以上原子或基团的5或6元杂环基、C(O)R⁵、C(O)OR⁵、C(O)NR⁵R⁶、OR⁵、SR⁵、S(O)_rR^{5x}、S(O)₂NR⁵R⁶、NR⁵R⁶、NR⁵C(O)R⁶、NR⁵C(O)OR⁶、硝基、氰基、卤素原子或者氢原子，

[0019] R⁵和R⁶独立地表示可具有选自组 α 中的1个以上原子或基团的C1-C6链式烃基、可具有选自组 β 中的1个以上原子或基团的C3-C9脂环式烃基、可具有选自组 γ 中的1个以上原子或基团的苯基、可具有选自组 γ 中的1个以上原子或基团的5或6元杂环基或者氢原子，

[0020] R^{5x}表示可具有选自组 α 中的1个以上原子或基团的C1-C6链式烃基、可具有选自组 β 中的1个以上原子或基团的C3-C9脂环式烃基、可具有选自组 γ 中的1个以上原子或基团的苯基或者可具有选自组 γ 中的1个以上原子或基团的5或6元杂环基，

[0021] Het表示下式H1、H2或H3：



[0023] (式中,Q表示氧原子或硫原子)，

[0024] Ar表示苯基或者5或6元芳香族杂环基，

[0025] G表示可具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基、可具有1以上卤素原子的C3-C6脂环式烃基、OR⁷、OS(O)₂R⁷、S(O)_mR⁷、NR⁸S(O)₂R⁷或卤素原子(在此,R⁷表示可具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基或者可具有1以上卤素原子的C3-C6脂环式烃基,R⁸表示氢原子、可具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基或者可具有1以上卤素原子的C3-C6脂环式烃基)，

[0026] n表示0、1或2，

[0027] m表示0、1或2，

[0028] r表示1或2，

[0029] p表示0、1、2或3(在此,在p表示2或3的情况下,R²各自可以相同或不同)，

[0030] q表示0、1、2、3或4(在此,在q表示2、3或4的情况下,R³各自可以相同或不同)。

[0031] 组 α 为包含下述的组：可具有1以上卤素原子的C1-C6烷氧基、可具有1以上卤素原子的C2-C6烯氧基、可具有1以上卤素原子的C2-C6炔氧基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷硫基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷基亚磺酰基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷基磺酰基、可具有1以上卤素原子的C2-C6烷基羰基、可具有1以上卤素原子的C2-C6烷氧基羰基、可具有1以上卤素原子或1以上C1-C3烷基的C3-C6环烷基、氰基、羟基和卤素原子。

[0032] 组 β 为包含下述的组：可具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷氧基、可具有1以上卤素原子的C2-C6烯氧基、可具有1以上卤素原子的C2-C6炔氧基和卤素原子。

[0033] 组 γ 为包含下述的组：可具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷氧基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷硫基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷基亚磺酰基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷基磺酰基、可具有1以上卤素原子的C2-C6烷基羰基、可具有1以上卤素原子的C2-C6烷氧基羰基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷基

氨基、可具有1以上卤素原子的C2-C8二烷基氨基、卤素原子、氰基和硝基。]

[0034] [2]如[1]所述的有害节肢动物防除剂,其中,Het为式H1所示的基团。

[0035] [3]如[1]所述的有害节肢动物防除剂,其中,Het为式H2所示的基团。

[0036] [4]如[1]所述的有害节肢动物防除剂,其中,Het为式H3所示的基团。

[0037] [5][1]~[4]中任一项所述的有害节肢动物防除剂,其中,Q为氧原子。

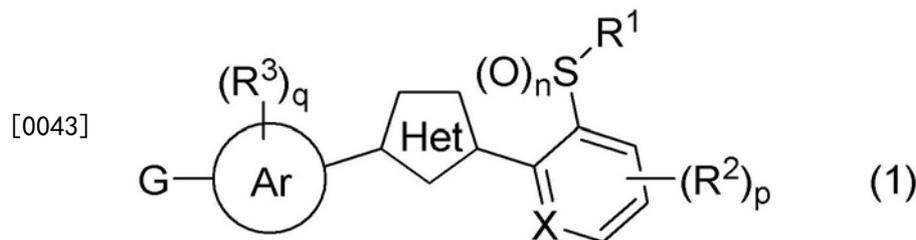
[0038] [6][1]~[4]中任一项所述的有害节肢动物防除剂,其中,Q为硫原子。

[0039] [7][1]~[6]中任一项所述的有害节肢动物防除剂,其中,X为氮原子。

[0040] [8][1]~[6]中任一项所述的有害节肢动物防除剂,其中,X为CR⁴。

[0041] [9][1]~[8]中任一项所述的有害节肢动物防除剂,其中,Ar为苯基或吡啶基。

[0042] [10]一种有害节肢动物防除方法,其将式(1)所示的二芳基-噻化合物或其N-氧化物的有效量向有害节肢动物或有害节肢动物的栖息场所施用,



[0044] [式中,

[0045] X表示氮原子或CR⁴,

[0046] R¹表示可具有选自组α中的1个以上原子或基团的C1-C6链式烃基或者可具有选自组β中的1个以上原子或基团的C3-C9脂环式烃基,

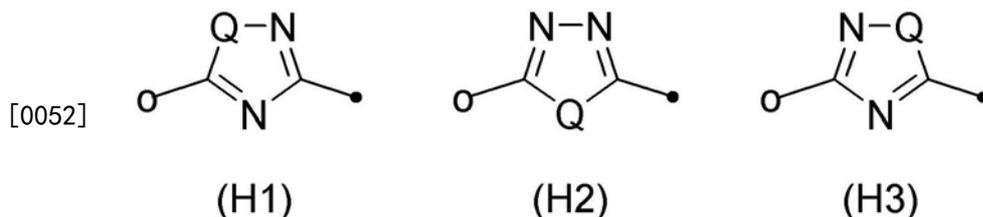
[0047] R²和R³独立地表示可具有选自组α中的1个以上原子或基团的C1-C6链式烃基、可具有选自组β中的1个以上原子或基团的C3-C9脂环式烃基、可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的苯基、可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的5或6元杂环基、C(O)R⁵、C(O)OR⁵、C(O)NR⁵R⁶、OR⁵、SR⁵、S(O)_rR^{5x}、S(O)₂NR⁵R⁶、NR⁵R⁶、NR⁵C(O)R⁶、NR⁵C(O)OR⁶、硝基、氰基或者卤素原子,

[0048] R⁴表示可具有选自组α中的1个以上原子或基团的C1-C6链式烃基、可具有选自组β中的1个以上原子或基团的C3-C9脂环式烃基、可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的苯基、可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的5或6元杂环基、C(O)R⁵、C(O)OR⁵、C(O)NR⁵R⁶、OR⁵、SR⁵、S(O)_rR^{5x}、S(O)₂NR⁵R⁶、NR⁵R⁶、NR⁵C(O)R⁶、NR⁵C(O)OR⁶、硝基、氰基、卤素原子或者氢原子,

[0049] R⁵和R⁶独立地表示可具有选自组α中的1个以上原子或基团的C1-C6链式烃基、可具有选自组β中的1个以上原子或基团的C3-C9脂环式烃基、可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的苯基、可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的5或6元杂环基或者氢原子,

[0050] R^{5x}表示可具有选自组α中的1个以上原子或基团的C1-C6链式烃基、可具有选自组β中的1个以上原子或基团的C3-C9脂环式烃基、可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的苯基或者可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的5或6元杂环基,

[0051] Het表示下式H1、H2或H3:



[0053] (式中, Q表示氧原子或硫原子),

[0054] Ar表示苯基或者5或6元芳香族杂环基,

[0055] G表示可具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基、可具有1以上卤素原子的C3-C6脂环式烃基、OR⁷、OS(O)₂R⁷、S(O)_mR⁷、NR⁸S(O)₂R⁷或卤素原子(在此, R⁷表示可具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基或者可具有1以上卤素原子的C3-C6脂环式烃基, R⁸表示氢原子、可具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基或者可具有1以上卤素原子的C3-C6脂环式烃基),

[0056] n表示0、1或2,

[0057] m表示0、1或2,

[0058] r表示1或2,

[0059] p表示0、1、2或3(在此, 在p表示2或3的情况下, R²各自可以相同或不同),

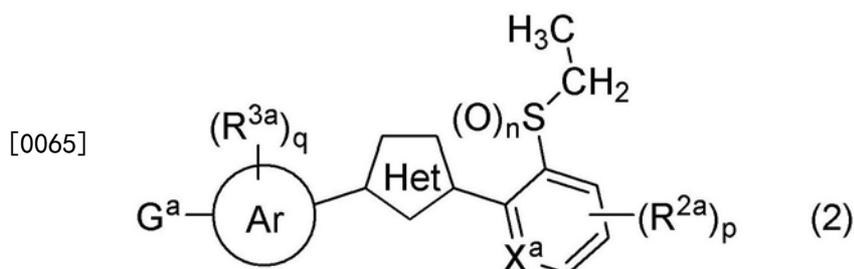
[0060] q表示0、1、2、3或4(在此, 在q表示2、3或4的情况下, R³各自可以相同或不同)。

[0061] 组α为包含下述的组: 可具有1以上卤素原子的C1-C6烷氧基、可具有1以上卤素原子的C2-C6烯氧基、可具有1以上卤素原子的C2-C6炔氧基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷硫基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷基亚磺酰基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷基磺酰基、可具有1以上卤素原子的C2-C6烷基羰基、可具有1以上卤素原子的C2-C6烷氧基羰基、可具有1以上卤素原子或1以上C1-C3烷基的C3-C6环烷基、氰基、羟基和卤素原子。

[0062] 组β为包含下述的组: 可具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷氧基、可具有1以上卤素原子的C2-C6烯氧基、可具有1以上卤素原子的C2-C6炔氧基和卤素原子。

[0063] 组γ为包含下述的组: 可具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷氧基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷硫基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷基亚磺酰基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷基磺酰基、可具有1以上卤素原子的C2-C6烷基羰基、可具有1以上卤素原子的C2-C6烷氧基羰基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷基氨基、可具有1以上卤素原子的C2-C8二烷基氨基、卤素原子、氰基和硝基。]

[0064] [11]式(2)所示的二芳基-唑化合物或其N-氧化物,



[0066] [式中,

[0067] X^a表示氮原子或CR^{4a},

[0068] R^{2a}和R^{3a}独立地表示可具有选自组α中的1个以上原子或基团的C1-C6链式烃基、可

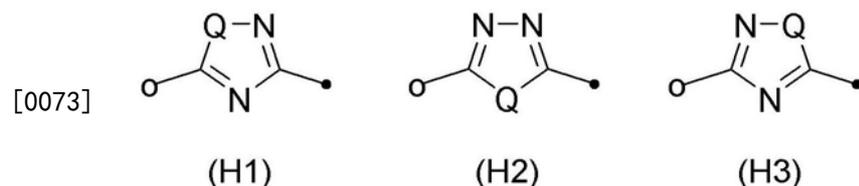
具有选自组β中的1个以上原子或基团的C3-C9脂环式烃基、可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的苯基、可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的5或6元杂环基、C(O)R^{5a}、C(O)OR^{5a}、C(O)NR^{5a}R^{6a}、OR^{5a}、SR^{5a}、S(O)_rR^{5y}、S(O)₂NR^{5a}R^{6a}、NR^{5a}R^{6a}、NR^{5a}C(O)R^{6a}、NR^{5a}C(O)OR^{6a}、硝基、氰基或者卤素原子，

[0069] R^{4a}表示可具有选自组α中的1个以上原子或基团的C1-C6链式烃基、可具有选自组β中的1个以上原子或基团的C3-C9脂环式烃基、可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的苯基、可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的5或6元杂环基、C(O)R^{5a}、C(O)OR^{5a}、C(O)NR^{5a}R^{6a}、OR^{5a}、SR^{5a}、S(O)_rR^{5y}、S(O)₂NR^{5a}R^{6a}、NR^{5a}R^{6a}、NR^{5a}C(O)R^{6a}、NR^{5a}C(O)OR^{6a}、硝基、氰基、卤素原子或者氢原子，

[0070] R^{5a}和R^{6a}独立地表示可具有选自组α中的1个以上原子或基团的C1-C6链式烃基、可具有选自组β中的1个以上原子或基团的C3-C9脂环式烃基、可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的苯基、可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的5或6元杂环基或者氢原子，

[0071] R^{5y}表示可具有选自组α中的1个以上原子或基团的C1-C6链式烃基、可具有选自组β中的1个以上原子或基团的C3-C9脂环式烃基、可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的苯基或者可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的5或6元杂环基，

[0072] Het表示下式H1、H2或H3：



[0074] (式中,Q表示氧原子或硫原子)，

[0075] Ar表示苯基或者5或6元芳香族杂环基，

[0076] G^a表示具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基、具有1以上卤素原子的C3-C6脂环式烃基、OR^{7a}、OS(O)₂R^{7a}、S(O)_mR^{7a}或NR^{8a}S(O)₂R^{7a}(在此,R^{7a}表示具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基、或者具有1以上卤素原子的C3-C6脂环式烃基,R^{8a}表示氢原子、可具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基、或者具有1以上卤素原子的C3-C6脂环式烃基)，

[0077] n表示0、1或2，

[0078] m表示0、1或2，

[0079] r表示1或2，

[0080] p表示0、1、2或3(在此,在p表示2或3的情况下,R^{2a}各自可以相同或不同)，

[0081] q表示0、1、2、3或4(在此,在q表示2、3或4的情况下,R^{3a}各自可以相同或不同)。

[0082] 组α为包含下述的组：可具有1以上卤素原子的C1-C6烷氧基、可具有1以上卤素原子的C2-C6烯氧基、可具有1以上卤素原子的C2-C6炔氧基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷硫基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷基亚磺酰基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷基磺酰基、可具有1以上卤素原子的C2-C6烷基羰基、可具有1以上卤素原子的C2-C6烷氧基羰基、可具有1以上卤素原子或1以上C1-C3烷基的C3-C6环烷基、氰基、羟基和卤素原子。

[0083] 组β为包含下述的组：可具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷氧基、可具有1以上卤素原子的C2-C6烯氧基、可具有1以上卤素原子的C2-C6炔氧基和卤素原子。

[0084] 组 γ 为包含下述的组：可具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷氧基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷硫基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷基亚磺酰基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷基磺酰基、可具有1以上卤素原子的C2-C6烷基羰基、可具有1以上卤素原子的C2-C6烷氧基羰基、可具有1以上卤素原子的C1-C6烷基氨基、可具有1以上卤素原子的C2-C8二烷基氨基、卤素原子、氰基和硝基。]

具体实施方式

[0085] 关于本说明书的记载中使用的基团，以下举例说明。

[0086] 本说明书中的“可具有1以上卤素原子的”中，在具有2以上卤素原子的情况下，这些卤素原子可以相互相同也可以相互不同。

[0087] 本说明书中的例如“C1-C6”的表述是指碳原子数为1至6。

[0088] 本说明书中，“C1-C6链式烃基”是指C1-C6烷基、C2-C6烯基和C2-C6炔基。

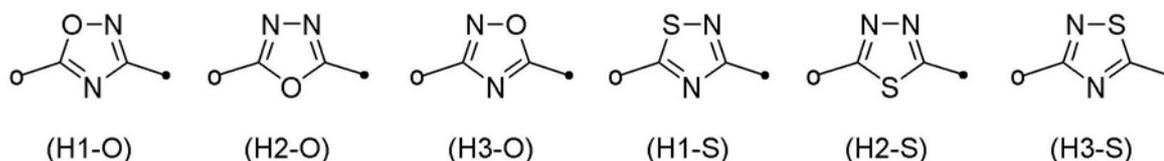
[0089] 本说明书中，“脂环式烃基”是指例如环烷基、环烯基。

[0090] 卤素原子是指氟原子、氯原子、溴原子和碘原子。

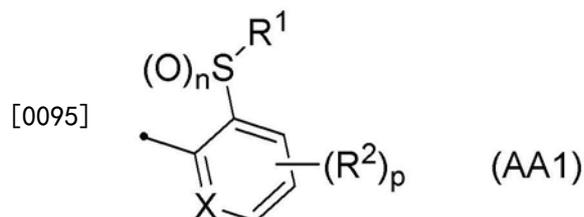
[0091] 杂环基是指除碳原子以外还含有1个以上氮原子、氧原子或硫原子作为构成环的原子的芳香族或非芳香族的杂环基，例如表示吡咯烷基、四氢呋喃基、四氢噻吩基等5元非芳香族杂环基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、呋喃基、噻吩基、噁唑基、噻唑基等5元芳香族杂环基、哌啶基、四氢吡喃基、四氢噻喃基、哌嗪基、吗啉基等6元非芳香族杂环基、和吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基等6元芳香族杂环基。

[0092] 本说明书中，“Het”是指具有2个碳原子、2个氮原子、和1个氧原子或硫原子作为构成环的原子的5元环，具体地可举出以下的式(H1-O)～式(H3-S)。

[0093]



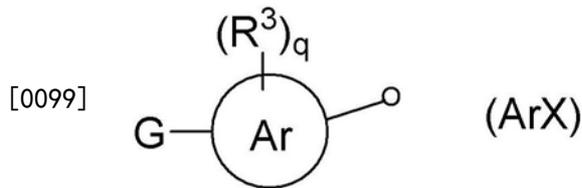
[0094] 式中，“○”表示与Ar的键合位置，“●”表示与式(AA1)的键合位置。



[0096] [式中，记号表示与式(1)相同的含义。]

[0097] 作为5或6元芳香族杂环基，例如可举出吡咯基、吡唑基、咪唑基、呋喃基、噻吩基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、和吡嗪基。

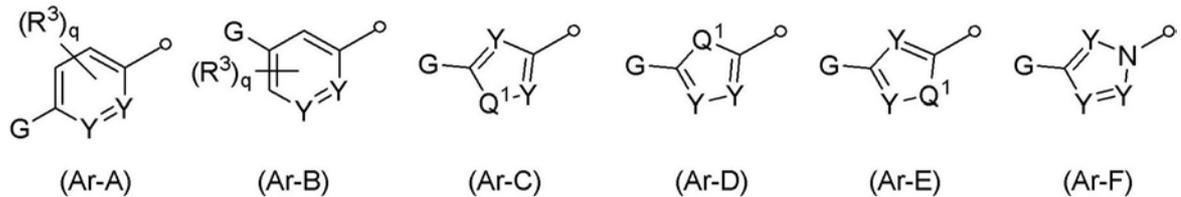
[0098] 本说明书中，将式(ArX)所示的结构表示为“(R³)_qGAr-”。



[0100] [式中, 记号表示与式(1)相同的含义。]

[0101] 作为“(R³)_qGAr-”, 例如可举出以下的式(Ar-A)~(Ar-F)。

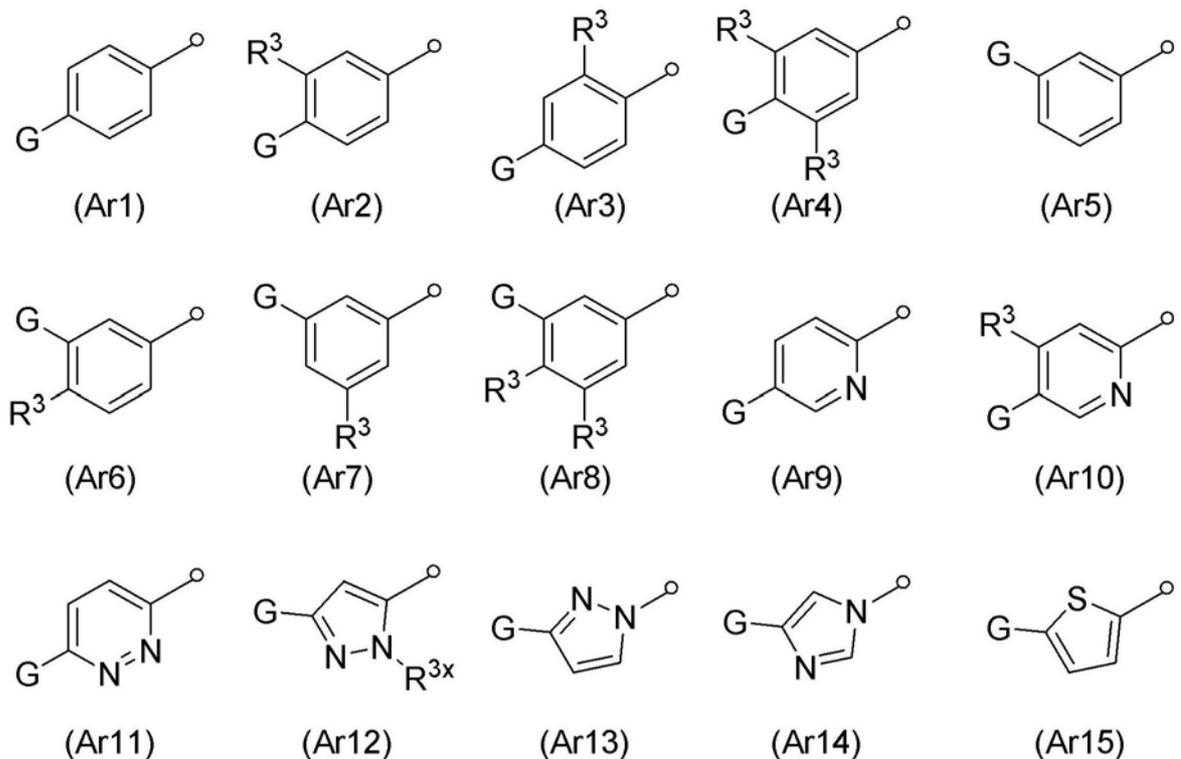
[0102]



[0103] [式中, Y独立表示氮原子、CH或CR³, Q¹表示NR^{3x}、氧原子或硫原子, R^{3x}表示氢原子、可具有选自组α中的1个以上原子或基团的C1-C6链式烃基、可具有选自组β中的1个以上原子或基团的C3-C9脂环式烃基、可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的苯基、可具有选自组γ中的1个以上原子或基团的5或6元杂环基、C(O)R⁵、C(O)OR⁵或C(O)NR⁵R⁶, 其他记号表示与式(1)相同的含义。]

[0104] 另外, 具体地可举出例如以下的式(Ar1)~(Ar15)。

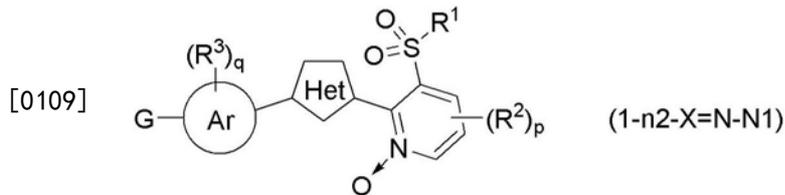
[0105]



[0106] [式中, 记号表示与式(1)相同的含义。]

[0107] 本说明书中, N-氧化物是指构成杂环的氮原子被氧化了的化合物。作为能够形成N-氧化物的杂环, 例如可举出吡啶环或哒嗪环。具体地可举出例如下式(1-n2-X=N-N1)。

[0108] 式(1-n2-X=N-N1)



[0110] [式中,记号表示与式(1)相同的含义。]

[0111] 作为本发明防除剂,例如可举出以下的防除剂。

[0112] (方式1)式(1)中, R^1 为可具有选自组 α 中的1个以上原子或基团的C1-C6链式烃基的本发明防除剂;

[0113] (方式2)方式1中, X 为氮原子或CH,

[0114] R^2 和 R^3 独立地为可具有选自组 α 中的1个以上原子或基团的C1-C6链式烃基或者卤素原子,

[0115] G 为可具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基、 $S(O)_mR^7$ 或卤素原子(在此, R^7 为可具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基),

[0116] p 为0或1,

[0117] q 为0或1的本发明防除剂;

[0118] (方式3)方式1~方式2中, R^1 为C1-C6烷基的本发明防除剂;

[0119] (方式4)方式1~方式2中, R^1 为C1-C3烷基的本发明防除剂;

[0120] (方式5)方式1~方式2中, R^1 为乙基的本发明防除剂;

[0121] (方式6)方式1~方式5中, R^2 、 R^3 和 G 独立地为可具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基或卤素原子的本发明防除剂;

[0122] (方式7)方式6中, R^2 、 R^3 和 G 独立地为可具有1以上卤素原子的C1-C6烷基或卤素原子的本发明防除剂;

[0123] (方式8)方式6中, R^2 、 R^3 和 G 独立地为可具有1以上卤素原子的C1-C3烷基或卤素原子的本发明防除剂;

[0124] (方式9)方式6中, R^2 、 R^3 和 G 独立地为三氟甲基或卤素原子的本发明防除剂;

[0125] (方式10)方式1~方式9中, Ar 为吡咯基的本发明防除剂;

[0126] (方式11)方式1~方式9中, Ar 为吡唑基的本发明防除剂;

[0127] (方式12)方式1~方式9中, Ar 为咪唑基的本发明防除剂;

[0128] (方式13)方式1~方式9中, Ar 为呋喃基的本发明防除剂;

[0129] (方式14)方式1~方式9中, Ar 为噻吩基的本发明防除剂;

[0130] (方式15)方式1~方式9中, Ar 为噁唑基的本发明防除剂;

[0131] (方式16)方式1~方式9中, Ar 为异噁唑基的本发明防除剂;

[0132] (方式17)方式1~方式9中, Ar 为噻唑基的本发明防除剂;

[0133] (方式18)方式1~方式9中, Ar 为异噻唑基的本发明防除剂;

[0134] (方式19)方式1~方式9中, Ar 为三唑基的本发明防除剂;

[0135] (方式20)方式1~方式9中, Ar 为1,2,4-噁二唑基的本发明防除剂;

[0136] (方式21)方式1~方式9中, Ar 为1,3,4-噁二唑基的本发明防除剂;

[0137] (方式22)方式1~方式9中, Ar 为1,2,4-噻二唑基的本发明防除剂;

[0138] (方式23)方式1~方式9中, Ar 为1,3,4-噻二唑基的本发明防除剂;

- [0139] (方式24)方式1~方式9中,Ar为吡啶基的本发明防除剂;
- [0140] (方式25)方式1~方式9中,Ar为嘧啶基的本发明防除剂;
- [0141] (方式26)方式1~方式9中,Ar为哒嗪基的本发明防除剂;
- [0142] (方式27)方式1~方式9中,Ar为吡嗪基的本发明防除剂;
- [0143] (方式28)方式1~方式9中,Ar为苯基的本发明防除剂;
- [0144] (方式29)方式1~方式28中,Het为H1的本发明防除剂;
- [0145] (方式30)方式1~方式28中,Het为H1-O的本发明防除剂;
- [0146] (方式31)方式1~方式28中,Het为H1-S的本发明防除剂;
- [0147] (方式32)方式1~方式28中,Het为H2的本发明防除剂;
- [0148] (方式33)方式1~方式28中,Het为H2-O的本发明防除剂;
- [0149] (方式34)方式1~方式28中,Het为H2-S的本发明防除剂;
- [0150] (方式35)方式1~方式28中,Het为H3的本发明防除剂;
- [0151] (方式36)方式1~方式28中,Het为H3-O的本发明防除剂;
- [0152] (方式37)方式1~方式28中,Het为H3-S的本发明防除剂;
- [0153] (方式38)方式1~方式37中,X为氮原子的本发明防除剂;
- [0154] (方式39)方式1~方式37中,X为CH的本发明防除剂;
- [0155] (方式40)式(2)中, X^a 为氮原子或CH,
- [0156] R^{2a} 和 R^{3a} 独立地表示可具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基或卤素原子,
- [0157] G^a 为具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基的化合物;
- [0158] (方式41)方式40中, R^{2a} 和 R^{3a} 独立地为可具有1以上卤素原子的C1-C6烷基或卤素原子的化合物;
- [0159] (方式42)方式40中, R^{2a} 和 R^{3a} 独立地为可具有1以上卤素原子的C1-C3烷基或卤素原子的化合物;
- [0160] (方式43)方式40中, R^{2a} 和 R^{3a} 独立地为三氟甲基或卤素原子的化合物;
- [0161] (方式44)方式40~方式43中, G^a 为具有1以上卤素原子的C1-C6链式烃基或 $S(O)_mR^{7a}$ 的化合物;
- [0162] (方式45)方式44中, G^a 为具有1以上卤素原子的C1-C6烷基的化合物;
- [0163] (方式46)方式44中, G^a 为具有1以上卤素原子的C1-C3烷基的化合物;
- [0164] (方式47)方式44中, G^a 为氟甲基的化合物;
- [0165] (方式48)方式40~方式46中,Ar为苯基、吡啶基、噻吩基、吡唑基、咪唑基、三唑基的化合物;
- [0166] (方式49)方式48中,Ar为苯基的化合物;
- [0167] (方式50)方式48中,Ar为吡啶基的化合物;
- [0168] (方式51)方式48中,Ar为噻吩基的化合物;
- [0169] (方式52)方式48中,Ar为吡唑基的化合物;
- [0170] (方式53)方式48中,Ar为咪唑基的化合物;
- [0171] (方式54)方式48中,Ar为三唑基的化合物;
- [0172] (方式57)方式40~方式43中,“(R³)_qGAr-”为3-(三氟甲基)苯基的化合物;
- [0173] (方式58)方式40~方式43中,“(R³)_qGAr-”为4-(三氟甲基)苯基的化合物;

- [0174] (方式59)方式40~方式43中,“(R³)_qGAr-”为3,5-双(三氟甲基)苯基的化合物;
 [0175] (方式60)方式40~方式59中,Het为H1的化合物;
 [0176] (方式61)方式40~方式59中,Het为H1-0的化合物;
 [0177] (方式62)方式40~方式59中,Het为H1-S的化合物;
 [0178] (方式63)方式40~方式59中,Het为H2的化合物;
 [0179] (方式64)方式40~方式59中,Het为H2-0的化合物;
 [0180] (方式65)方式40~方式59中,Het为H2-S的化合物;
 [0181] (方式66)方式40~方式59中,Het为H3的化合物;
 [0182] (方式67)方式40~方式59中,Het为H3-0的化合物;
 [0183] (方式68)方式40~方式59中,Het为H3-S的化合物;
 [0184] (方式69)方式40~方式68中,X^a为氮原子的化合物;
 [0185] (方式70)方式40~方式68中,X^a为CH的化合物。

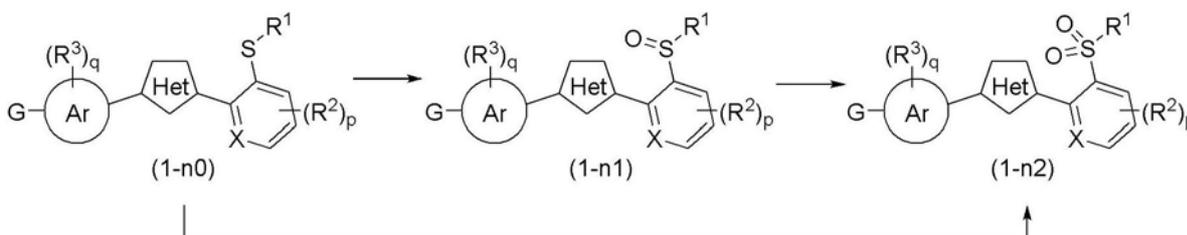
[0186] 接着,对本化合物的制造法进行说明。

[0187] 本化合物和制造中间体化合物例如可以通过以下的(制造法1)~(制造法14)来制造。

[0188] (制造法1)

[0189] 式(1)中,n为1的本化合物(以下,记作本化合物(1-n1))或n为2的本化合物(以下,记作本化合物(1-n2))可以通过将n为0的本化合物(以下,记作本化合物(1-n0))氧化来制造。

[0190]



[0191] [式中,记号表示与式(1)相同的含义。]

[0192] 式(1)中,本化合物(1-n1)可以通过将本化合物(1-n0)进行氧化反应来制造。

[0193] 该反应通常在溶剂的存在下进行。

[0194] 作为反应中使用的溶剂,例如可举出二氯甲烷、氯仿等脂肪族卤代烃类、甲醇、乙醇等醇类、乙酸乙酯等酯类、乙酸、水和它们的混合物。

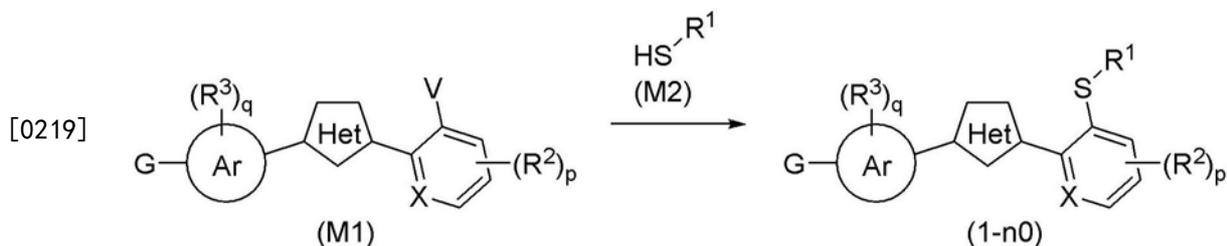
[0195] 作为反应中使用的氧化剂,例如可举出过碘酸钠和间氯过苯甲酸。

[0196] 该反应中,相对于本化合物(1-n0)1摩尔,氧化剂通常以1~1.5摩尔的比例使用。优选相对于本化合物(1-n0)1摩尔,氧化剂以1~1.2摩尔的比例使用。

[0197] 该反应的反应温度通常为-50~50℃的范围。该反应的反应时间通常为0.1~12小时的范围。

[0198] 反应结束后,反应混合物用有机溶剂萃取,有机层根据需要要用还原剂(例如亚硫酸钠、硫代硫酸钠)的水溶液、碱(例如碳酸氢钠)的水溶液清洗、干燥、浓缩等,通过进行这些后处理操作能够分离本化合物(1-n1)。分离出的本化合物(1-n1)也可以通过色谱、重结晶等进一步进行精制。

- [0199] 本化合物(1-n2)可以通过对本化合物(1-n1)进行氧化来制造。
- [0200] 该反应通常在溶剂的存在下进行。
- [0201] 作为反应中使用的溶剂,例如可举出二氯甲烷、氯仿等脂肪族卤代烃类、甲醇、乙醇等醇类、乙酸乙酯等酯类、乙酸、水和它们的混合物。
- [0202] 作为反应中使用的氧化剂,例如可举出间氯过苯甲酸、过氧化氢水和OXONE(注册商标)。
- [0203] 该反应也可以根据需要在催化剂的存在下进行。
- [0204] 作为反应中使用的催化剂,例如可举出钨酸、钨酸钠和钨酸钾。
- [0205] 该反应中,相对于本化合物(1-n1)1摩尔,氧化剂通常以1~4摩尔的比例使用,催化剂通常以0.01~0.5摩尔的比例使用。优选相对于本化合物(1-n1)1摩尔,氧化剂以1~2摩尔的比例使用,催化剂以0.05~0.2摩尔的比例使用。
- [0206] 该反应的反应温度通常为-50~100℃的范围。该反应的反应时间通常为0.1~12小时的范围。
- [0207] 反应结束后,反应混合物用有机溶剂萃取,有机层根据需要用还原剂(例如亚硫酸钠、硫代硫酸钠)的水溶液、碱(例如碳酸氢钠)的水溶液清洗、干燥、浓缩等,通过进行这些后处理操作能够分离本化合物(1-n2)。本化合物(1-n2)也可以通过色谱、重结晶等进一步进行精制。
- [0208] 另外,式(1)中,n为2的本化合物(1-n2)可以通过对n为0的本化合物(1-n0)进行氧化利用一阶段反应(一锅)来制造。
- [0209] 该反应通常在溶剂的存在下进行。
- [0210] 作为反应中使用的溶剂,例如可举出二氯甲烷、氯仿等脂肪族卤代烃类、甲醇、乙醇等醇类、乙酸乙酯等酯类、乙酸、水和它们的混合物。
- [0211] 作为反应中使用的氧化剂,例如可举出间氯过苯甲酸、过氧化氢水和OXONE(注册商标)。
- [0212] 该反应也可以根据需要在催化剂的存在下进行。
- [0213] 作为反应中使用的催化剂,例如可举出钨酸、钨酸钠和钨酸钾。
- [0214] 该反应中,相对于本化合物(1-n0)1摩尔,氧化剂通常以2~5摩尔的比例使用,催化剂通常以0.01~0.5摩尔的比例使用。优选相对于本化合物(1-n0)1摩尔,氧化剂以2~3摩尔的比例使用,催化剂以0.05~0.2摩尔的比例使用。
- [0215] 该反应的反应温度通常为0~120℃的范围。该反应的反应时间通常为0.1~12小时的范围。
- [0216] 反应结束后,反应混合物用有机溶剂萃取,有机层根据需要用还原剂(例如亚硫酸钠、硫代硫酸钠)的水溶液、碱(例如碳酸氢钠)的水溶液清洗、干燥、浓缩等,通过进行这些后处理操作能够分离本化合物(1-n2)。分离出的本化合物(1-n2)也可以通过色谱、重结晶等进一步进行精制。
- [0217] (制造法2)
- [0218] 本化合物(1-n0)可以通过使式(M1)所示的化合物(以下,记作中间体化合物(M1))与式(M2)所示的化合物(以下,记作化合物(M2))在碱的存在下进行反应来制造。



[0220] [式中,V表示卤素原子,其他记号表示与式(1)相同的含义。]

[0221] 该反应通常在溶剂的存在下进行。

[0222] 作为反应中使用的溶剂,例如可举出四氢呋喃(以下,记作THF)、乙二醇二甲基醚、叔丁基甲基醚、1,4-二噁烷等醚类、甲苯、二甲苯等芳香族烃类、乙腈等腈类、N,N-二甲基甲酰胺(以下,记作DMF)、N-甲基吡咯烷酮(以下,记作NMP)、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮、二甲基亚砜(以下,记作DMSO)等非质子极性溶剂、水和它们的混合物。

[0223] 作为反应中使用的碱,例如可举出碳酸钠、碳酸钾等碱金属碳酸盐类、氢氧化钠等碱金属氢化物类。

[0224] 该反应中,相对于中间体化合物(M1)1摩尔,化合物(M2)通常以1~10摩尔的比例使用,碱通常以1~10摩尔的比例使用。

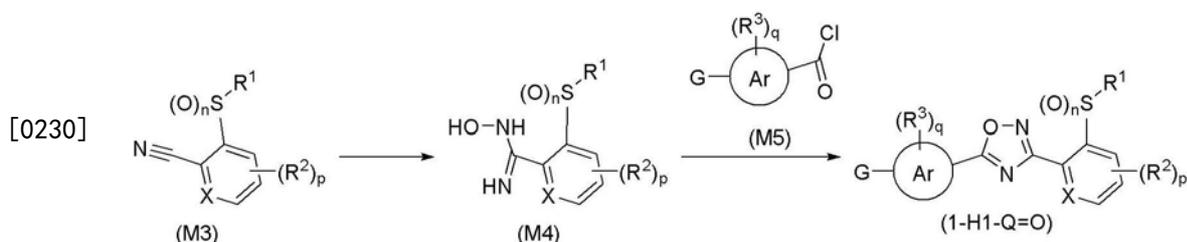
[0225] 该反应的反应温度通常为-50~100℃的范围。该反应的反应时间通常为0.1~12小时的范围。

[0226] 反应结束后,向反应混合物中加入水后,用有机溶剂进行萃取,将有机层干燥、浓缩等,通过进行这些后处理操作能够分离本化合物(1-n0)。分离出的本化合物(1-n0)也可以通过色谱、重结晶等进一步进行精制。

[0227] 该反应中,作为V,优选氟原子和氯原子。

[0228] (制造法3)

[0229] 式(1)中,Het为H1、Q为氧原子的化合物(以下,记作本化合物(1-H1-Q=O))可以通过使式(M4)所示的化合物(以下,记作中间体化合物(M4))与式(M5)所示的化合物(以下,记作中间体化合物(M5))反应来制造。



[0231] [式中,记号表示与式(1)相同的含义。]

[0232] 中间体化合物(M4)可以通过使式(M3)所示的化合物(以下,记作中间体化合物(M3))与羟基胺在碱的存在下进行反应来制造。

[0233] 该反应通常在溶剂的存在下进行。

[0234] 作为反应中使用的溶剂,例如可举出甲醇、乙醇等醇类、THF、乙二醇二甲基醚、叔丁基甲基醚、1,4-二噁烷等醚类、甲苯、二甲苯等芳香族烃类、乙腈等腈类、DMF、NMP、DMSO等非质子极性溶剂、水和它们的混合物。

[0235] 作为反应中使用的碱,例如可举出碳酸钠、碳酸钾等碱金属碳酸盐类、氢氧化钠等碱

金属氢化物类。

[0236] 该反应中,相对于中间体化合物(M3) 1摩尔,羟基胺通常以1~10摩尔的比例使用,碱通常以1~10摩尔的比例使用。

[0237] 该反应的反应温度通常为0~150℃的范围。该反应的反应时间通常为0.1~24小时的范围。

[0238] 反应结束后,向反应混合物中加入水后,用有机溶剂进行萃取,将有机层干燥、浓缩等,通过进行这些后处理操作能够分离中间体化合物(M4)。分离出的中间体化合物(M4)也可以通过色谱、重结晶等进一步进行精制。

[0239] 本化合物(1-H1-Q=O)可以通过使中间体化合物(M4)与中间体化合物(M5)在碱的存在下进行反应来制造。

[0240] 该反应通常在溶剂的存在下进行。

[0241] 作为反应中使用的溶剂,例如可举出甲醇、乙醇等醇类、THF、乙二醇二甲基醚、叔丁基甲基醚、1,4-二噁烷等醚类、己烷、庚烷、辛烷等脂肪族烃类、甲苯、二甲苯等芳香族烃类、氯苯等卤代烃类、乙酸乙酯、乙酸丁基等酯类、乙腈等腈类、DMF、NMP、DMSO等非质子性极性溶剂、吡啶、喹啉等含氮芳香族化合物类和它们的混合物。

[0242] 作为反应中使用的碱,可举出碳酸钠、碳酸钾等碱金属碳酸盐类、三乙基胺、N,N-二异丙基乙基胺等叔胺类、和吡啶、4-二甲基氨基吡啶等含氮芳香族化合物类等。

[0243] 该反应中,相对于中间体化合物(M4) 1摩尔,中间体化合物(M5)通常以1~3摩尔的比例使用,碱通常以1~5摩尔的比例使用。

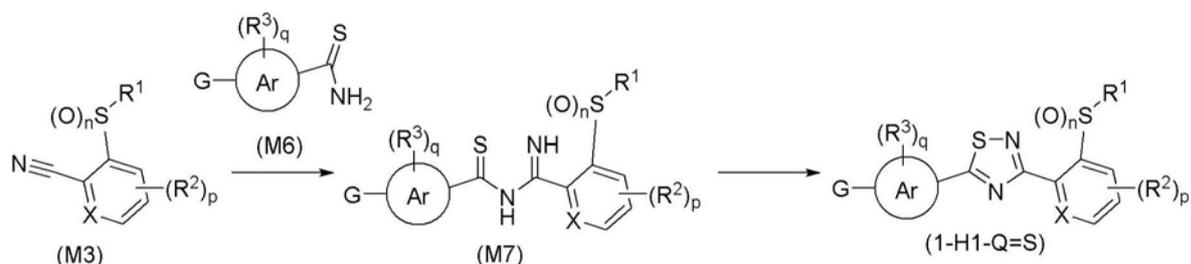
[0244] 该反应的反应温度通常为0~200℃的范围。该反应的反应时间通常为0.1~24小时的范围。

[0245] 反应结束后,向反应混合物中加入水后,用有机溶剂进行萃取,将有机层干燥、浓缩等,通过进行这些后处理操作能够分离本化合物(1-H1-Q=O)。分离出的本化合物(1-H1-Q=O)也可以通过色谱、重结晶等进一步进行精制。

[0246] (制造法4)

[0247] 式(1)中,Het为H1、Q为硫原子的化合物(以下,记作本化合物(1-H1-Q=S))可以通过使式(M7)所示的化合物(以下,记作中间体化合物(M7))与氧化剂反应来制造。

[0248]



[0249] [式中,记号表示与式(1)相同的含义。]

[0250] 中间体化合物(M7)可以通过使中间体化合物(M3)与式(M6)所示的化合物(以下,记作中间体化合物(M6))在酸的存在下反应来制造。

[0251] 该反应通常在溶剂的存在下进行。

[0252] 作为反应中使用的溶剂,例如可举出THF、乙二醇二甲基醚、叔丁基甲基醚、1,4-二

噁烷等醚类、水和它们的混合物。

[0253] 作为反应中使用的酸,可举出盐酸、硝酸、磷酸、硫酸等无机酸类。

[0254] 该反应中,相对于中间体化合物 (M3) 1摩尔,中间体化合物 (M6) 通常以1~3摩尔的比例使用,酸通常以0.1~10摩尔的比例使用。

[0255] 该反应的反应温度通常为0~200℃的范围。该反应的反应时间通常为0.1~24小时的范围。

[0256] 反应结束后,向反应混合物中加入水后,用有机溶剂进行萃取,将有机层干燥、浓缩等,通过进行这些后处理操作能够分离中间体化合物 (M7)。分离出的中间体化合物 (M7) 也可以通过色谱、重结晶等进一步进行精制。

[0257] 本化合物 (1-H1-Q=S) 可以通过使式 (M7) 所示的化合物 (以下,记作中间体化合物 (M7)) 与氧化剂反应来制造。

[0258] 该反应通常在溶剂的存在下进行。

[0259] 作为反应中使用的溶剂,例如可举出甲醇、乙醇等醇类、THF、乙二醇二甲基醚、叔丁基甲基醚、1,4-二噁烷等醚类、乙酸、水和它们的混合物。

[0260] 作为反应中使用的氧化剂,可举出溴、碘、硝酸、过氧化氢水溶液、和高氯酸、和它们的混合物。

[0261] 该反应中,相对于中间体化合物 (M7) 1摩尔,氧化剂通常以1~10摩尔的比例使用。

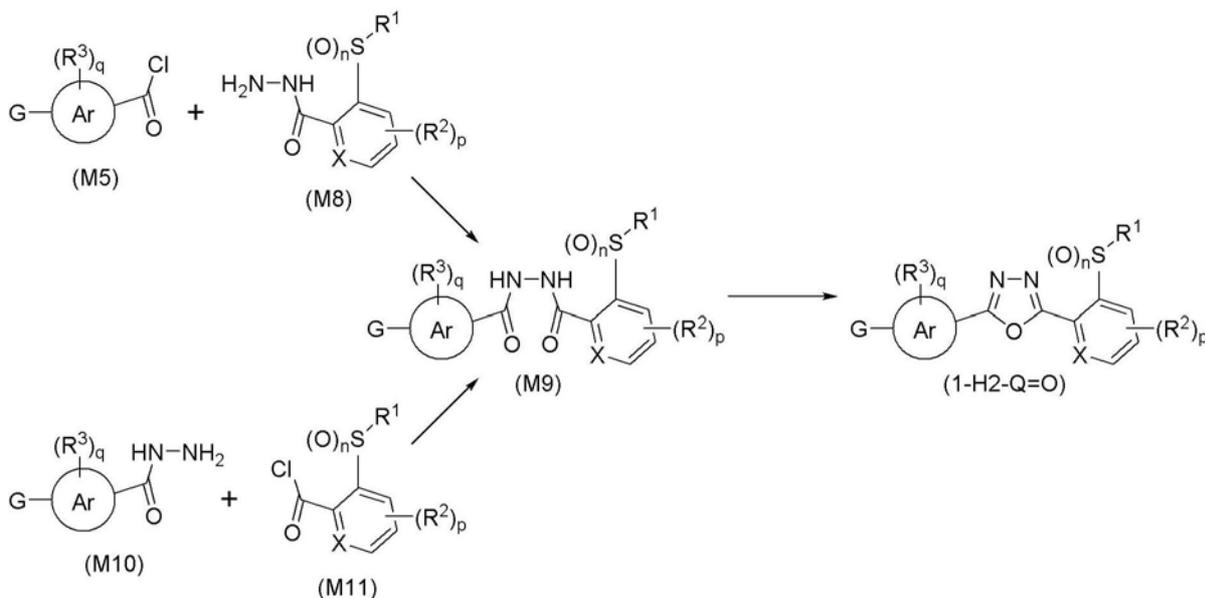
[0262] 该反应的反应温度通常为0~150℃的范围。该反应的反应时间通常为0.1~24小时的范围。

[0263] 反应结束后,向反应混合物中加入水后,用有机溶剂进行萃取,将有机层干燥、浓缩等,通过进行这些后处理操作能够分离本化合物 (1-H1-Q=S)。分离出的本化合物 (1-H1-Q=S) 也可以通过色谱、重结晶等进一步进行精制。

[0264] (制造法5)

[0265] 式 (1) 中,Het为H2、Q为氧原子的化合物 (以下,记作本化合物 (1-H2-Q=O)) 可以通过使式 (M9) 所示的化合物 (以下,记作中间体化合物 (M9)) 与脱水剂反应来制造。

[0266]



[0267] [式中,记号表示与式(1)相同的含义。]

[0268] 中间体化合物(M9)可以通过使中间体化合物(M5)与中间体化合物(M8)反应来制造。

[0269] 该反应通常在溶剂的存在下进行。作为溶剂,例如可举出THF、乙二醇二甲基醚、叔丁基甲基醚、1,4-二噁烷等醚类、己烷、庚烷、辛烷等脂肪族烃类、甲苯、二甲苯等芳香族烃类、氯苯等卤代烃类、乙酸乙酯、乙酸丁基等酯类、乙腈等腈类、DMF、NMP、DMSO等非质子性极性溶剂和它们的混合物。

[0270] 该反应也可以根据需要加入碱来进行。作为碱,可举出碳酸钠、碳酸钾等碱金属碳酸盐类、三乙基胺、N,N-二异丙基乙基胺等叔胺类和吡啶、4-二甲基氨基吡啶等含氮芳香族化合物类等。

[0271] 该反应中,相对于中间体化合物(M5)1摩尔,中间体化合物(M8)通常以0.8~1.2摩尔的比例使用,碱通常以1~2摩尔的比例使用。

[0272] 反应温度通常为-20~200℃的范围。反应时间通常为0.1~24小时的范围。

[0273] 反应结束后,向反应混合物中加入水后,用有机溶剂进行萃取,将有机层干燥、浓缩等,通过进行这些后处理操作能够分离中间体化合物(M9)。分离出的中间体化合物(M9)也可以通过色谱、重结晶等进一步进行精制。

[0274] 另外,中间体化合物(M9)可以通过代替中间体化合物(M5)而使用式(M11)所示的化合物(以下,记作中间体化合物(M11))、代替中间体化合物(M8)而使用式(M10)所示的化合物(以下,记作中间体化合物(M10)),按照上述记载的方法来制造。

[0275] 本化合物(1-H2-Q=O)可以通过使中间体化合物(M9)与脱水剂反应来制造。

[0276] 该反应通常在溶剂的存在下进行。作为溶剂,例如可举出THF、乙二醇二甲基醚、叔丁基甲基醚、1,4-二噁烷等醚类、己烷、庚烷、辛烷等脂肪族烃类、甲苯、二甲苯等芳香族烃类、氯苯等卤代烃类、乙腈等腈类、DMF、NMP、DMSO等非质子性极性溶剂和它们的混合物。

[0277] 作为脱水剂,例如可举出二氯亚砷、氧氯化磷、五氯化磷等氯化试剂、乙酸酐、三氟甲烷磺酸酐等酸酐。

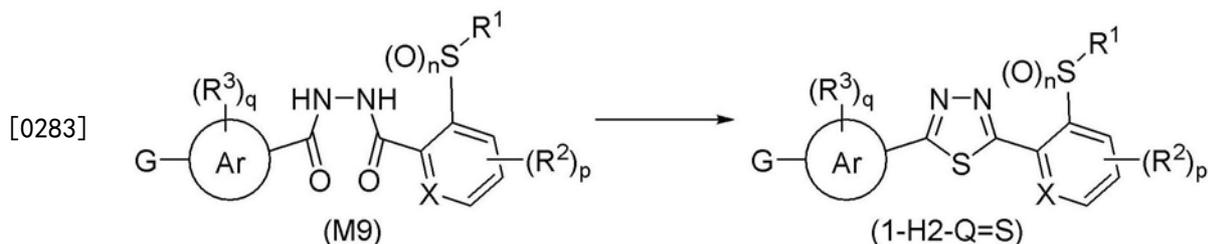
[0278] 该反应中,相对于中间体化合物(M9)1摩尔,脱水剂通常以1~10摩尔的比例使用。

[0279] 反应温度通常为0℃~200℃的范围。反应时间通常为0.1~24小时的范围。

[0280] 反应结束后,向反应混合物中加入水后,用有机溶剂进行萃取,将有机层干燥、浓缩等,通过进行这些后处理操作能够分离本化合物(1-H2-Q=O)。分离出的本化合物(1-H2-Q=O)也可以通过色谱、重结晶等进一步进行精制。

[0281] (制造法6)

[0282] 式(1)中,Het为H2、Q为硫原子的化合物(以下,记作本化合物(1-H2-Q=S))可以通过使中间体化合物(M9)在硫化剂的存在下进行环化来制造。



[0284] [式中,记号表示与式(1)相同的含义。]

[0285] 该反应通常在溶剂的存在下进行。作为溶剂,例如可举出THF、乙二醇二甲基醚、叔丁基甲基醚、1,4-二噁烷等醚类、己烷、庚烷、辛烷等脂肪族烃类、甲苯、二甲苯等芳香族烃类、氯苯等卤素化烃类和它们的混合物。

[0286] 作为反应中使用的硫化剂,例如可举出五硫化二磷、2,4-双(4-甲氧基苯基)-1,3,2,4-二硫代二磷-2,4-二硫醚(以下,记作劳森试剂)等。

[0287] 该反应中,相对于中间体化合物(M9)1摩尔,硫化剂通常以1~10摩尔的比例使用。

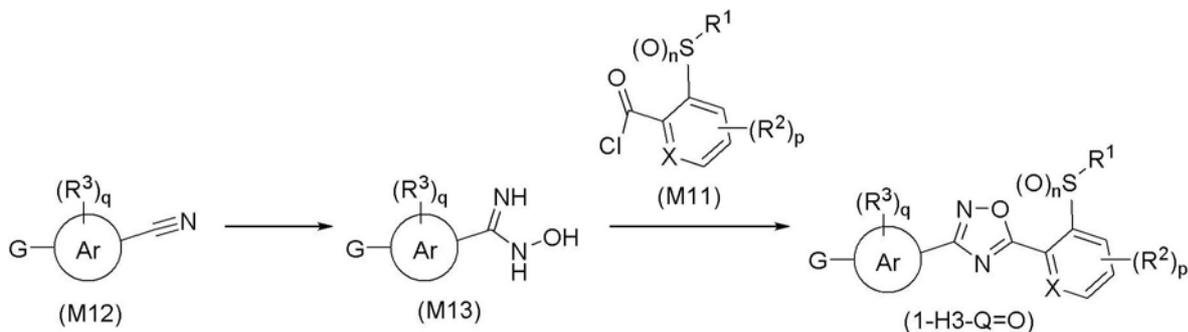
[0288] 反应温度通常为0℃~200℃的范围。反应时间通常为0.1~24小时的范围。

[0289] 反应结束后,向反应混合物中加入水后,用有机溶剂进行萃取,将有机层干燥、浓缩等,通过进行这些后处理操作能够分离本化合物(1-H2-Q=O)。分离出的本化合物(1-H2-Q=O)也可以通过色谱、重结晶等进一步进行精制。

[0290] (制造法7)

[0291] 式(1)中,Het为H3、Q为氧原子的化合物(以下,记作本化合物(1-H3-Q=O))可以通过使式(M13)所示的化合物(以下,记作中间体化合物(M13))与式(M11)所示的化合物(以下,记作中间体化合物(M11))进行反应来制造。

[0292]



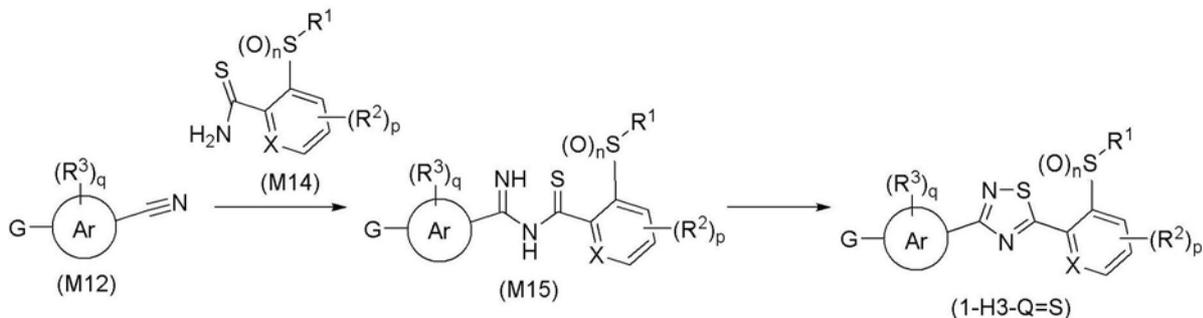
[0293] [式中,记号表示与式(1)相同的含义。]

[0294] 该反应可以按照制造法3中记载的方法来实施。

[0295] (制造法8)

[0296] 式(1)中,Het为H3、Q为硫原子的化合物(以下,记作本化合物(1-H3-Q=S))可以通过使式(M15)所示的化合物(以下,记作中间体化合物(M15))与氧化剂反应来制造。

[0297]



[0298] [式中,记号表示与式(1)相同的含义。]

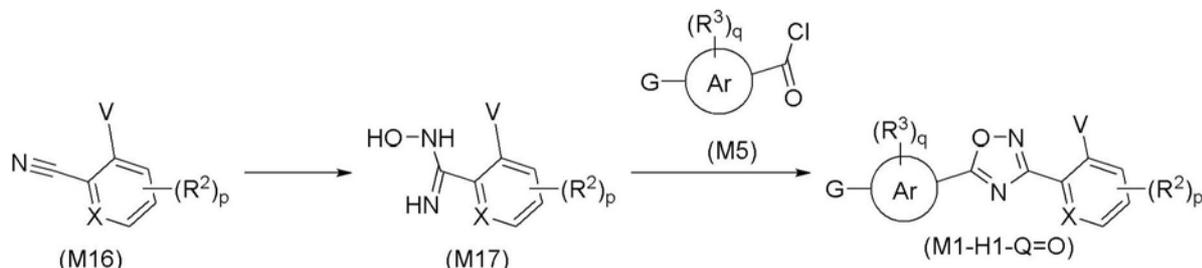
[0299] 该反应可以按照制造法4中记载的方法来实施。

[0300] (制造法9)

[0301] 中间体化合物(M1)中,Het为H1、Q为氧原子的化合物(以下,记作中间体化合物

(M1-H1-Q=O) 可以通过使式 (M17) 所示的化合物 (以下, 记作中间体化合物 (M17)) 与中间体化合物 (M5) 反应来制造。

[0302]



[0303] [式中, 记号表示与上述相同的含义。]

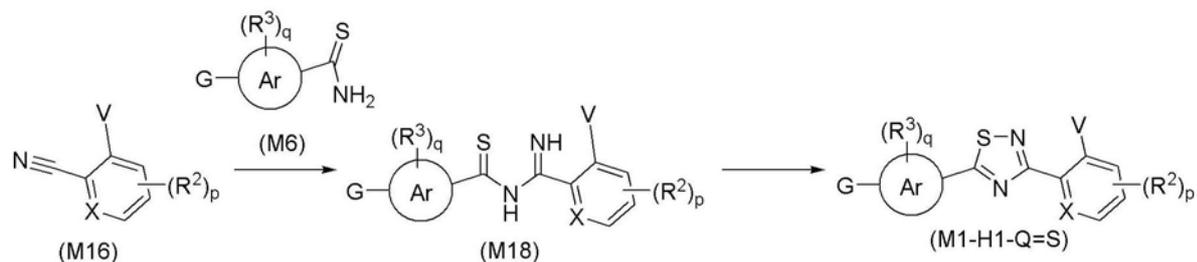
[0304] 代替中间体化合物 (M3) 而使用式 (M16) 所示的化合物 (以下, 记作中间体化合物 (M16)), 按照制造法3的方法, 可以制造中间体化合物 (M17)。

[0305] 代替中间体化合物 (M4) 而使用中间体化合物 (M17), 按照制造法3中记载的方法可以制造中间体化合物 (M1-H1-Q=O)。

[0306] (制造法10)

[0307] 中间体化合物 (M1) 中, Het为H1、Q为硫原子的化合物 (以下, 记作中间体化合物 (M1-H1-Q=S)) 可以通过使式 (M18) 所示的化合物 (以下, 记作中间体化合物 (M18)) 与氧化剂反应来制造。

[0308]



[0309] [式中, 记号表示与上述相同的含义。]

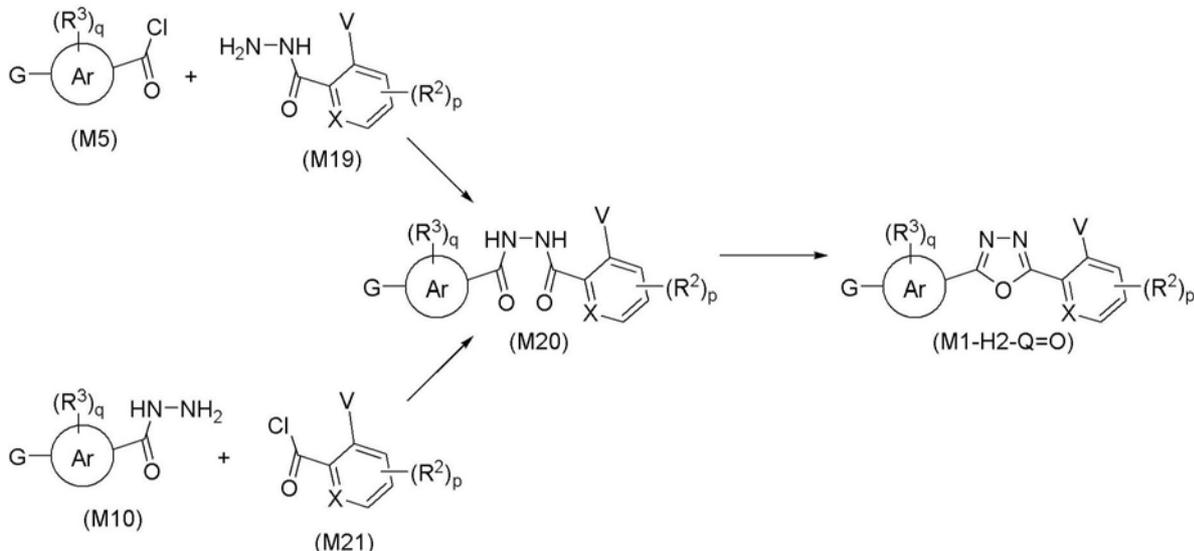
[0310] 代替中间体化合物 (M3) 而使用中间体化合物 (M16), 按照制造法4中记载的方法可以制造中间体化合物 (M18)。

[0311] 代替中间体化合物 (M7) 而使用中间体化合物 (M18), 按照制造法4中记载的方法可以制造中间体化合物 (M1-H1-Q=S)。

[0312] (制造法11)

[0313] 中间体化合物 (M1) 中, Het为H2、Q为氧原子的化合物 (以下, 记作中间体化合物 (M1-H2-Q=O)) 可以通过使式 (M20) 所示的化合物 (以下, 记作中间体化合物 (M20)) 与脱水剂反应来制造。

[0314]



[0315] [式中,记号表示与上述相同的含义。]

[0316] 代替中间体化合物 (M8) 而使用式 (M19) 所示的化合物 (以下,记作中间体化合物 (M19)),按照制造法5中记载的方法,可以制造中间体化合物 (M20)。

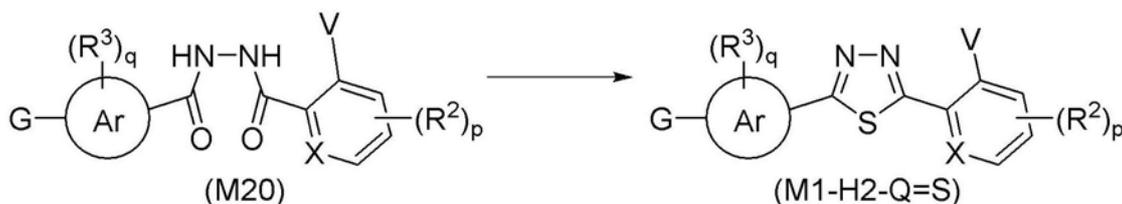
[0317] 代替中间体化合物 (M11) 而使用式 (M21) 所示的化合物 (以下,记作中间体化合物 (M21)),按照制造法5中记载的方法,可以制造中间体化合物 (M20)。

[0318] 代替中间体化合物 (M9) 而使用中间体化合物 (M20),按照制造法5中记载的方法,可以制造中间体化合物 (M1-H2-Q=O)。

[0319] (制造法12)

[0320] 中间体化合物 (M1) 中,Het为H2、Q为硫原子的化合物 (以下,记作中间体化合物 (M1-H2-Q=S)) 可以通过使中间体化合物 (M20) 在硫化剂的存在下环化来制造。

[0321]

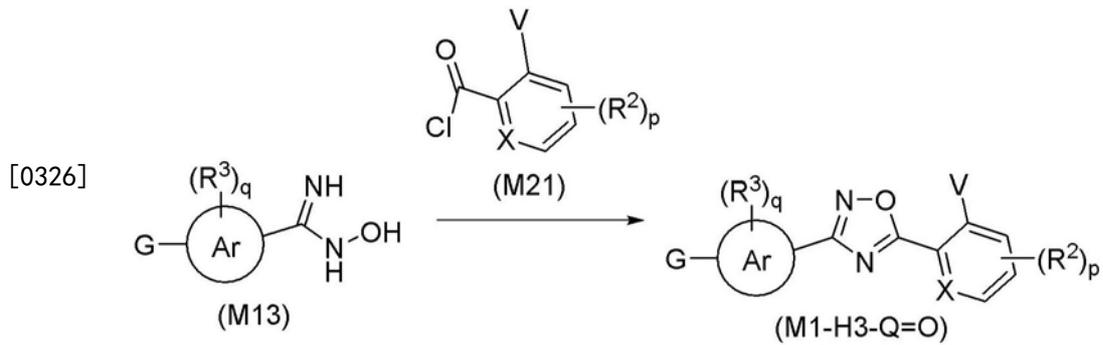


[0322] [式中,记号表示与上述相同的含义。]

[0323] 代替中间体化合物 (M9) 而使用中间体化合物 (M20),按照制造法6中记载的方法,可以制造中间体化合物 (M1-H2-Q=S)。

[0324] (制造法13)

[0325] 中间体化合物 (M1) 中,Het为H3、Q为氧原子的化合物 (以下,记作中间体化合物 (M1-H3-Q=O)) 可以通过使中间体化合物 (M13) 与中间体化合物 (M21) 反应来制造。



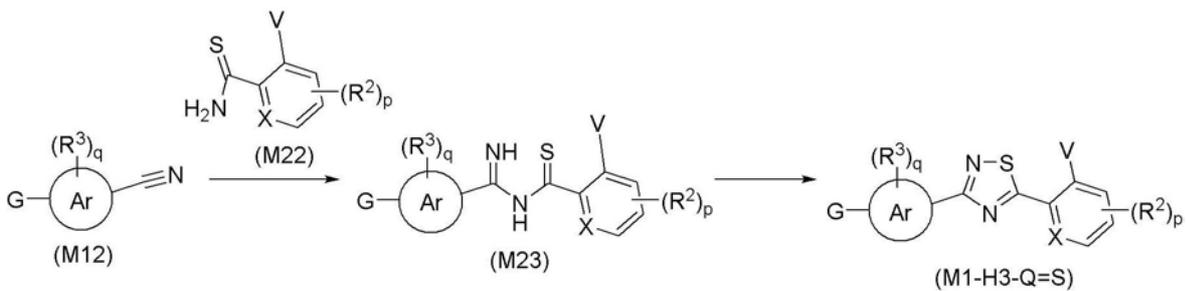
[0327] [式中,记号表示与上述相同的含义。]

[0328] 代替中间体化合物 (M11) 而使用中间体化合物 (M21), 按照制造法7中记载的方法, 可以制造中间体化合物 (M1-H3-Q=O)。

[0329] (制造法14)

[0330] 中间体化合物 (M1) 中, Het 为 H3、Q 为硫原子的化合物 (以下, 记作中间体化合物 (M1-H3-Q=S)) 可以通过使式 (M23) 所示的化合物 (以下, 记作中间体化合物 (M23)) 与氧化剂反应来制造。

[0331]



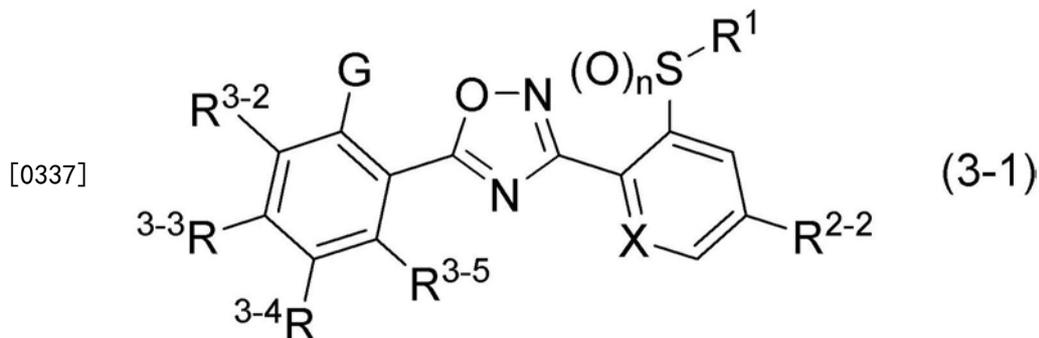
[0332] [式中,记号表示与上述相同的含义。]

[0333] 代替中间体化合物 (M14), 而使用式 (M23) 所示的化合物 (以下, 记作中间体化合物 (M22)), 按照制造法8中记载的方法, 可以制造中间体化合物 (M23)。

[0334] 代替中间体化合物 (M15) 而使用中间体化合物 (M23), 按照制造法8中记载的方法, 可以制造中间体化合物 (M1-H3-Q=S)。

[0335] 接着, 以下示出本发明化合物的具体例。

[0336] 式 (3-1) 所示的化合物中,



[0338] X 为 N, R^{2-2} 为 H, R^1 、n、X、G、 R^{3-2} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为 [表A] 中记载的任一组合的本发明化合物 [表中, Pr 表示丙基, Bu 表示丁基, Pen 表示戊基, cPr 表示环丙基。]。

[0339] [表A]

[0340]

R ¹	n	G	R ³⁻²	R ³⁻³	R ³⁻⁴	R ³⁻⁵
CH ₂ CH ₃	0	CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	1	CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	SCF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	S(O)CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	S(O) ₂ CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	OS(O) ₂ CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	F	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	Cl	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	F	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	Cl	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	Br	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	CF ₃	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	CH ₃	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	OCH ₃	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	NH ₂	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	CN	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	NO ₂	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	F	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	Cl	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	Br	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	CF ₃	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	CH ₃	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	OCH ₃	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	H	F
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	H	Cl
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	H	Br
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	H	CF ₃
CH ₃	2	OCF ₃	H	H	H	H
Pr	2	cPr	H	H	H	H
Bu	2	Cl	H	SCH ₃	H	H
Pen	2	NHSO ₂ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH=CH ₂	2	CF ₂ CF ₃	H	H	H	H
cPr	2	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	H	H	H

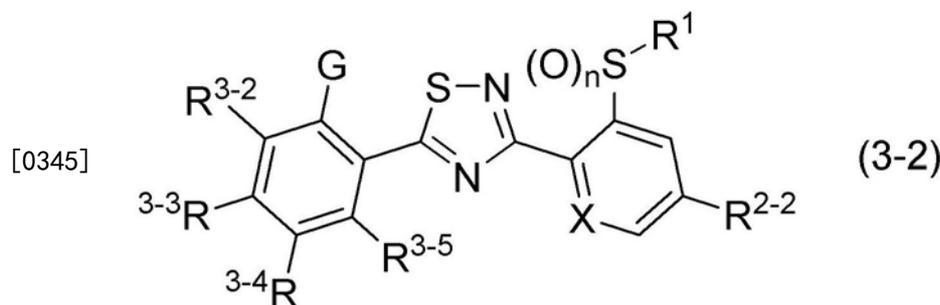
[0341] 式(3-1)所示的化合物中,X为N,R²⁻²为CF₃,R¹、n、X、G、R³⁻²、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表A]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0342] 式(3-1)所示的化合物中,X为CH,R²⁻²为H,R¹、n、X、G、R³⁻²、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表A]中

记载的任一组合的本发明化合物。

[0343] 式 (3-1) 所示的化合物中, X 为 CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、X、G、 R^{3-2} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为 [表 A] 中记载的任一组合的本发明化合物。

[0344] 式 (3-2)



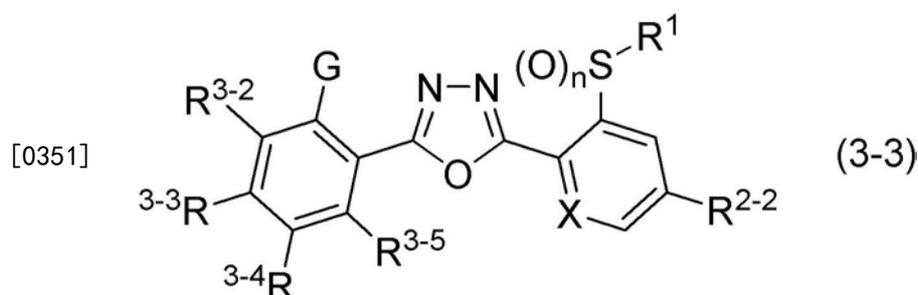
[0346] 所示的化合物中, X 为 N, R^{2-2} 为 H, R^1 、n、X、G、 R^{3-2} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为 [表 A] 中记载的任一组合的本发明化合物。

[0347] 式 (3-2) 所示的化合物中, X 为 N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、X、G、 R^{3-2} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为 [表 A] 中记载的任一组合的本发明化合物。

[0348] 式 (3-2) 所示的化合物中, X 为 CH, R^{2-2} 为 H, R^1 、n、X、G、 R^{3-2} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为 [表 A] 中记载的任一组合的本发明化合物。

[0349] 式 (3-2) 所示的化合物中, X 为 CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、X、G、 R^{3-2} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为 [表 A] 中记载的任一组合的本发明化合物。

[0350] 式 (3-3)



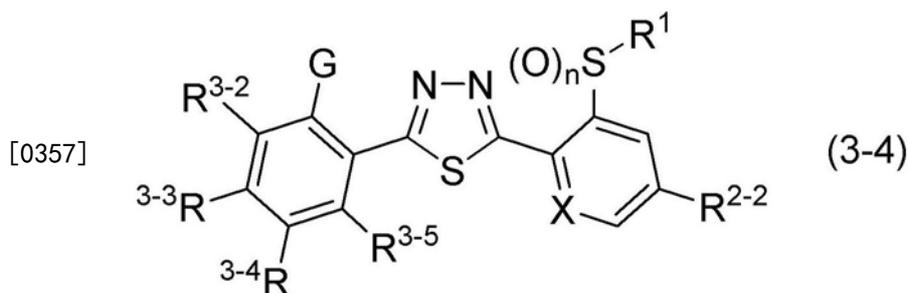
[0352] 所示的化合物中, X 为 N, R^{2-2} 为 H, R^1 、n、X、G、 R^{3-2} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为 [表 A] 中记载的任一组合的本发明化合物。

[0353] 式 (3-3) 所示的化合物中, X 为 N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、X、G、 R^{3-2} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为 [表 A] 中记载的任一组合的本发明化合物。

[0354] 式 (3-3) 所示的化合物中, X 为 CH, R^{2-2} 为 H, R^1 、n、X、G、 R^{3-2} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为 [表 A] 中记载的任一组合的本发明化合物。

[0355] 式 (3-3) 所示的化合物中, X 为 CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、X、G、 R^{3-2} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为 [表 A] 中记载的任一组合的本发明化合物。

[0356] 式 (3-4)



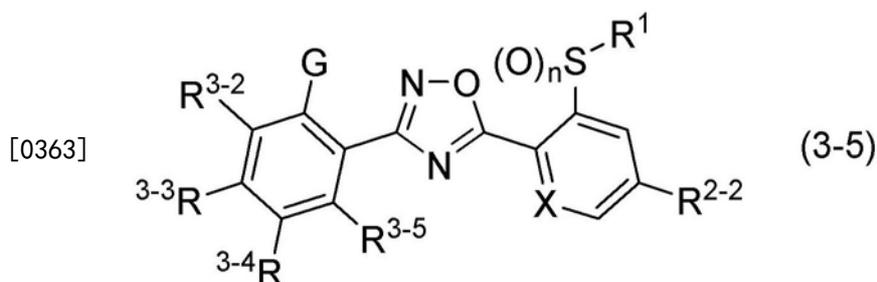
[0358] 所示的化合物中, X为N, R²⁻²为H, R¹、n、X、G、R³⁻²、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表A]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0359] 式(3-4)所示的化合物中, X为N, R²⁻²为CF₃, R¹、n、X、G、R³⁻²、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表A]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0360] 式(3-4)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为H, R¹、n、X、G、R³⁻²、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表A]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0361] 式(3-4)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为CF₃, R¹、n、X、G、R³⁻²、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表A]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0362] 式(3-5)



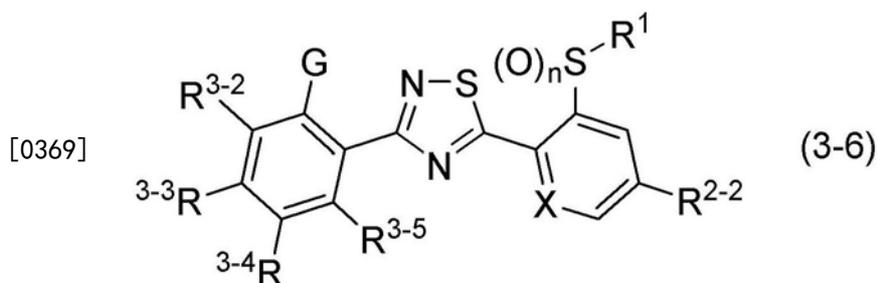
[0364] 所示的化合物中, X为N, R²⁻²为H, R¹、n、X、G、R³⁻²、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表A]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0365] 式(3-5)所示的化合物中, X为N, R²⁻²为CF₃, R¹、n、X、G、R³⁻²、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表A]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0366] 式(3-5)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为H, R¹、n、X、G、R³⁻²、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表A]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0367] 式(3-5)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为CF₃, R¹、n、X、G、R³⁻²、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表A]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0368] 式(3-6)



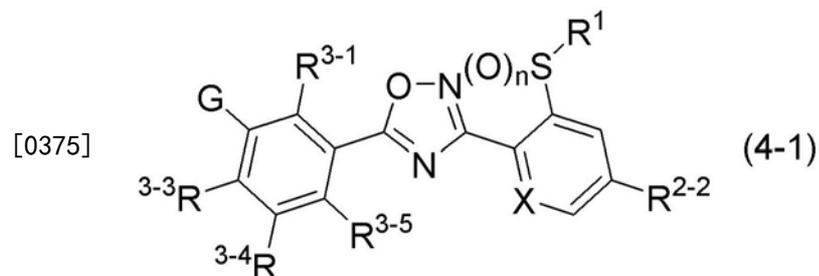
[0370] 所示的化合物中, X为N, R²⁻²为H, R¹、n、X、G、R³⁻²、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表A]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0371] 式(3-6)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、X、G、 R^{3-2} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表A]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0372] 式(3-6)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、X、G、 R^{3-2} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表A]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0373] 式(3-6)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、X、G、 R^{3-2} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表A]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0374] 式(4-1)



[0376] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0377] [表B]

[0378]

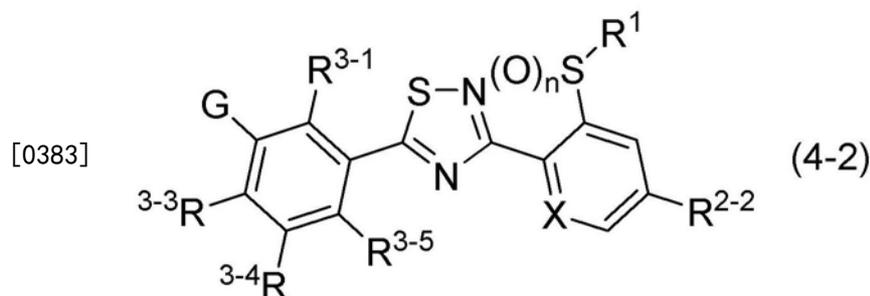
R ¹	n	G ²	R ³⁻¹	R ³⁻³	R ³⁻⁴	R ³⁻⁵
CH ₂ CH ₃	0	CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	1	CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	SCF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	S(O)CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	S(O) ₂ CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	OS(O) ₂ CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	F	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	Cl	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	Br	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	F	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	Cl	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	Br	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	CF ₃	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	CH ₃	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	OCH ₃	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	NO ₂	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	F	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	Cl	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	Br	H
CH ₂ CH ₃	0	CF ₃	H	H	CF ₃	H
CH ₂ CH ₃	1	CF ₃	H	H	CF ₃	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	CF ₃	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	CH ₃	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	OCH ₃	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	CN	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	NO ₂	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	NH ₂	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	C ₆ H ₅	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	H	F
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	H	Cl
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	H	Br
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	F	F	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	F	Cl	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₂ CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	CF ₂ CF ₃	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	CF ₂ CF ₂ C F ₃	H

[0379] 式(4-1)所示的化合物中,X为N,R²⁻²为CF₃,R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0380] 式(4-1)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0381] 式(4-1)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0382] 式(4-2)



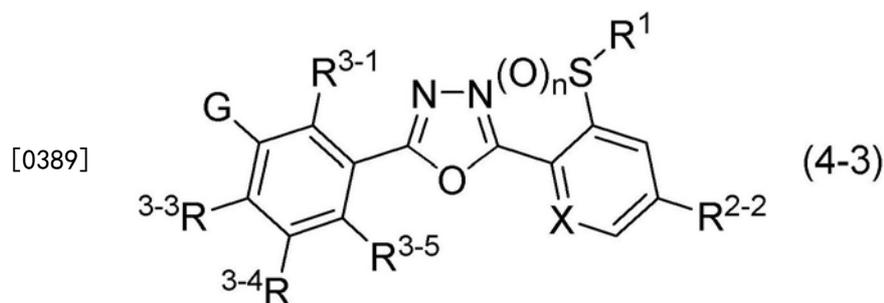
[0384] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0385] 式(4-2)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0386] 式(4-2)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0387] 式(4-2)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0388] 式(4-3)



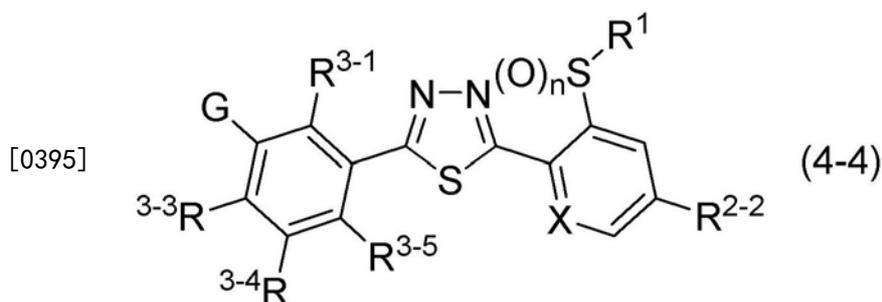
[0390] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0391] 式(4-3)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0392] 式(4-3)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0393] 式(4-3)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0394] 式(4-4)



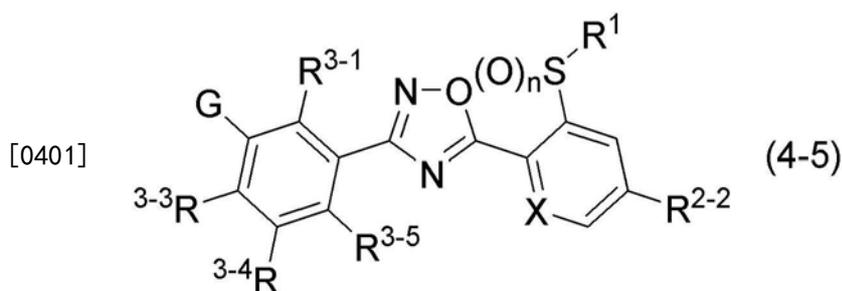
[0396] 所示的化合物中, X为N, R²⁻²为H, R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0397] 式(4-4)所示的化合物中, X为N, R²⁻²为CF₃, R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0398] 式(4-4)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为H, R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0399] 式(4-4)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为CF₃, R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0400] 式(4-5)



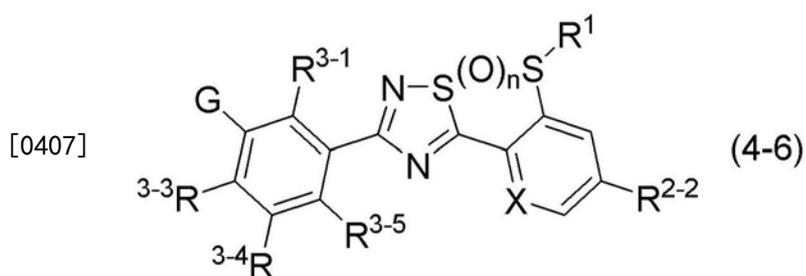
[0402] 所示的化合物中, X为N, R²⁻²为H, R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0403] 式(4-5)所示的化合物中, X为N, R²⁻²为CF₃, R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0404] 式(4-5)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为H, R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0405] 式(4-5)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为CF₃, R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0406] 式(4-6)



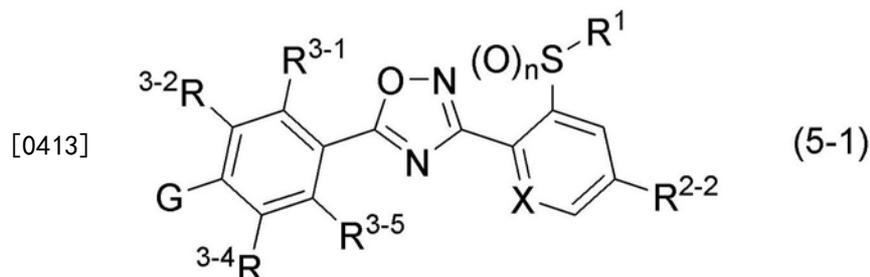
[0408] 所示的化合物中, X为N, R²⁻²为H, R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻³、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0409] 式(4-6)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0410] 式(4-6)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0411] 式(4-6)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表B]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0412] 式(5-1)



[0414] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-2} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0415] [表C]

[0416]

R^1	n	G	R^{3-1}	R^{3-2}	R^{3-4}	R^{3-5}
CH ₂ CH ₃	0	CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	1	CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	SCF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	S(O)CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	S(O) ₂ CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	OS(O) ₂ CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	F	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	Cl	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	Br	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	CH ₃	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	OCH ₃	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	CN	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	NO ₂	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	F	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	Cl	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	Br	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	CH ₃	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	OCH ₃	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	CN	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	NO ₂	H	H

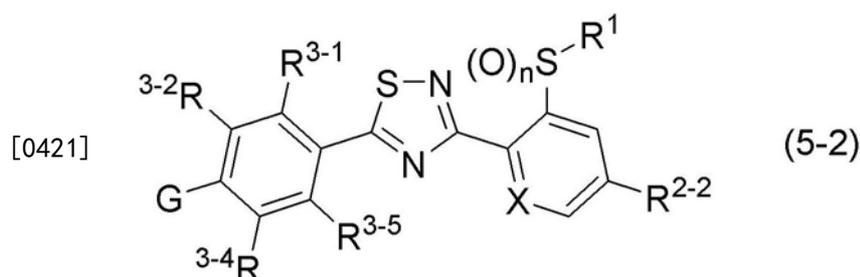
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	F	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	Cl	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₃	H	H	Br	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₂ CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH ₃	2	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	H	H	H

[0417] 式(5-1)所示的化合物中,X为N,R²⁻²为CF₃,R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻²、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0418] 式(5-1)所示的化合物中,X为CH,R²⁻²为H,R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻²、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0419] 式(5-1)所示的化合物中,X为CH,R²⁻²为CF₃,R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻²、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0420] 式(5-2)



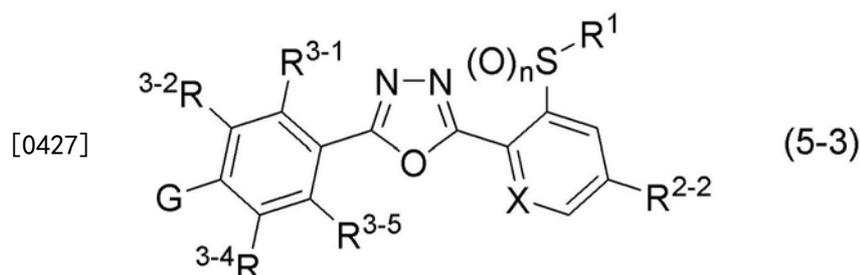
[0422] 所示的化合物中,X为N,R²⁻²为H,R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻²、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0423] 式(5-2)所示的化合物中,X为N,R²⁻²为CF₃,R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻²、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0424] 式(5-2)所示的化合物中,X为CH,R²⁻²为H,R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻²、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0425] 式(5-2)所示的化合物中,X为CH,R²⁻²为CF₃,R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻²、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0426] 式(5-3)



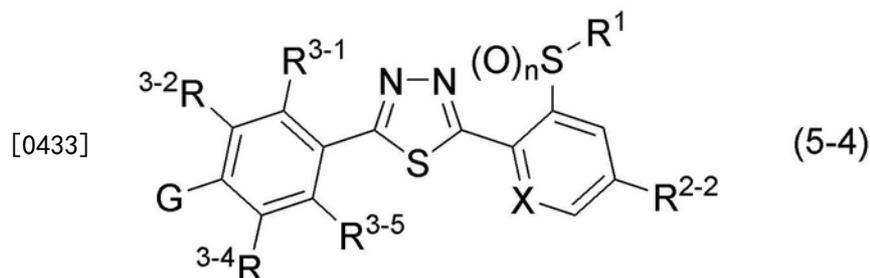
[0428] 所示的化合物中,X为N,R²⁻²为H,R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻²、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0429] 式(5-3)所示的化合物中,X为N,R²⁻²为CF₃,R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻²、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0430] 式(5-3)所示的化合物中,X为CH,R²⁻²为H,R¹、n、G、R³⁻¹、R³⁻²、R³⁻⁴和R³⁻⁵为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0431] 式(5-3)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-2} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0432] 式(5-4)



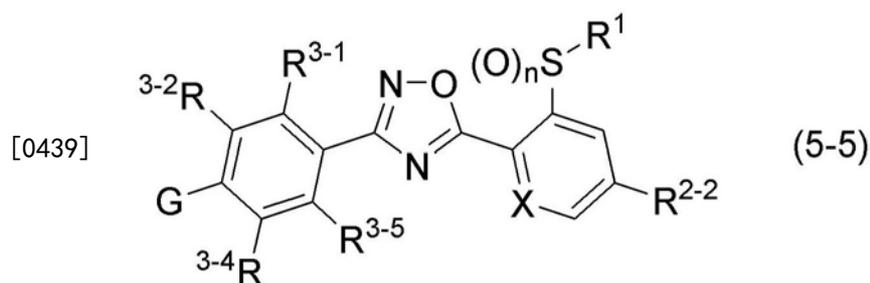
[0434] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-2} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0435] 式(5-4)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-2} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0436] 式(5-4)所示的化合物中, X为H, R^{2-2} 为CH, R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-2} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0437] 式(5-4)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-2} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0438] 式(5-5)



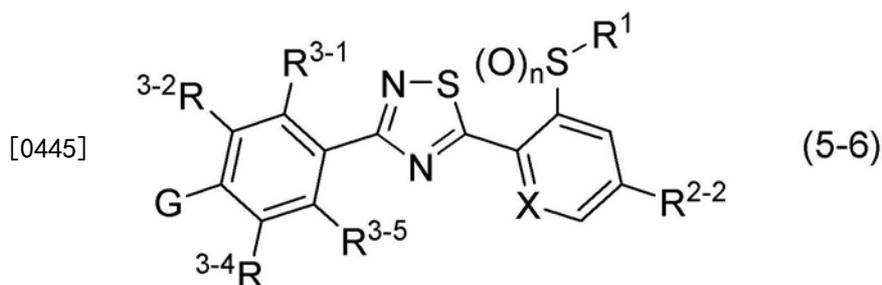
[0440] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-2} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0441] 式(5-5)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-2} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0442] 式(5-5)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-2} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0443] 式(5-5)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-2} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0444] 式(5-6)



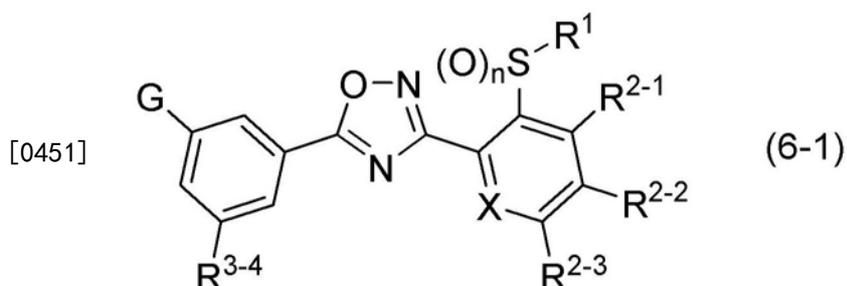
[0446] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-2} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0447] 式(5-6)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-2} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0448] 式(5-6)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-2} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0449] 式(5-6)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、G、 R^{3-1} 、 R^{3-2} 、 R^{3-4} 和 R^{3-5} 为[表C]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0450] 式(6-1)



[0452] 所示的化合物中, X为N, R^1 、n、 R^{2-1} 、 R^{2-2} 、 R^{2-3} 、G和 R^{3-4} 为[表D]中记载的任一组合的本发明化合物。

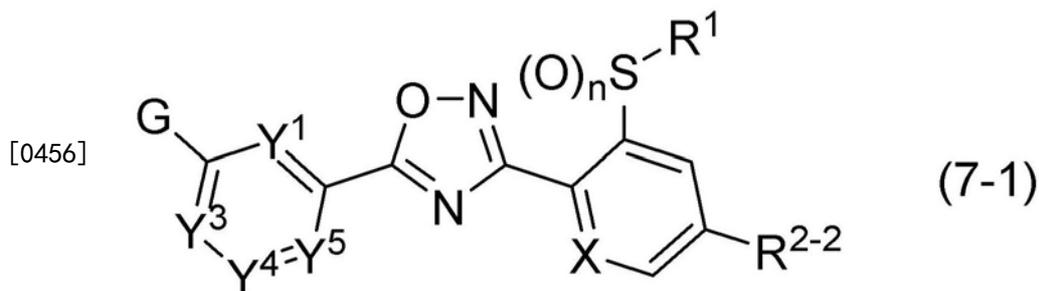
[0453] [表D]

[0454]

R^1	n	R^{2-1}	R^{2-2}	R^{2-3}	G	R^{3-4}
CH_2CH_3	2	CH_3	H	H	CF_3	CF_3
CH_2CH_3	2	CH_3	H	H	CF_3	H
CH_2CH_3	2	OCH_3	H	H	CF_3	CF_3
CH_2CH_3	2	OCH_3	H	H	CF_3	H
CH_2CH_3	2	Cl	H	H	CF_3	CF_3
CH_2CH_3	2	Cl	H	H	CF_3	H
CH_2CH_3	2	H	CH_3	H	CF_3	CF_3
CH_2CH_3	2	H	CH_3	H	CF_3	H
CH_2CH_3	2	H	OCH_3	H	CF_3	CF_3
CH_2CH_3	2	H	OCH_3	H	CF_3	H
CH_2CH_3	2	H	Cl	H	CF_3	CF_3
CH_2CH_3	2	H	Cl	H	CF_3	H

CH ₂ CH ₃	2	H	H	CH ₃	CF ₃	CF ₃
CH ₂ CH ₃	2	H	H	CH ₃	CF ₃	H
CH ₂ CH ₃	2	H	H	OCH ₃	CF ₃	CF ₃
CH ₂ CH ₃	2	H	H	OCH ₃	CF ₃	H
CH ₂ CH ₃	2	H	H	Cl	CF ₃	CF ₃
CH ₂ CH ₃	2	H	H	Cl	CF ₃	H
CH ₂ CH ₃	2	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H
CH ₂ CH ₃	2	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H

[0455] 式(7-1)



[0457] 所示的化合物中, X为N, R²⁻²为H, R¹、n、Y¹、Y³、Y⁴、Y⁵和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0458] [表E]

[0459]

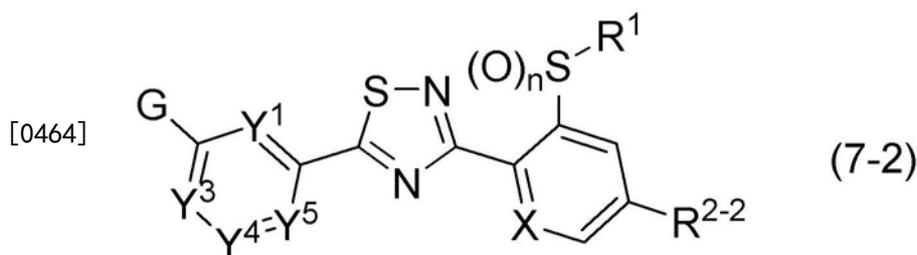
R ¹	n	Y ¹	Y ³	Y ⁴	Y ⁵	G
CH ₂ CH ₃	2	N	CH	CH	CH	CF ₃
CH ₂ CH ₃	2	CH	N	CH	CH	CF ₃
CH ₂ CH ₃	2	CH	CH	N	CH	CF ₃
CH ₂ CH ₃	2	CH	CH	CH	N	CF ₃
CH ₂ CH ₃	2	CH	CH	N	N	CF ₃
CH ₂ CH ₃	2	N	CH	CH	N	CF ₃
CH ₂ CH ₃	2	N	CH	N	CH	CF ₃

[0460] 式(7-1)所示的化合物中, X为N, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Y¹、Y³、Y⁴、Y⁵和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0461] 式(7-1)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为H, R¹、n、Y¹、Y³、Y⁴、Y⁵和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0462] 式(7-1)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Y¹、Y³、Y⁴、Y⁵和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0463] 式(7-2)



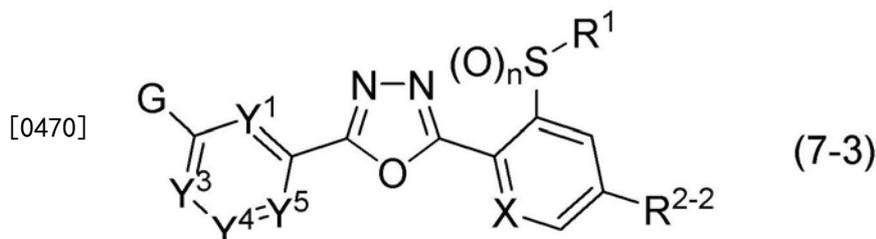
[0465] 所示的化合物中, X为N, R²⁻²为H, R¹、n、Y¹、Y³、Y⁴、Y⁵和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0466] 式(7-2)所示的化合物中, X为N, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Y¹、Y³、Y⁴、Y⁵和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0467] 式(7-2)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为H, R¹、n、Y¹、Y³、Y⁴、Y⁵和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0468] 式(7-2)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Y¹、Y³、Y⁴、Y⁵和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0469] 式(7-3)



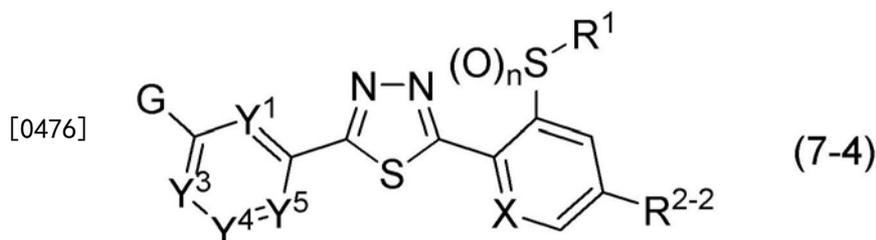
[0471] 所示的化合物中, X为N, R²⁻²为H, R¹、n、Y¹、Y³、Y⁴、Y⁵和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0472] 式(7-3)所示的化合物中, X为N, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Y¹、Y³、Y⁴、Y⁵和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0473] 式(7-3)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为H, R¹、n、Y¹、Y³、Y⁴、Y⁵和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0474] 式(7-3)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Y¹、Y³、Y⁴、Y⁵和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0475] 式(7-4)



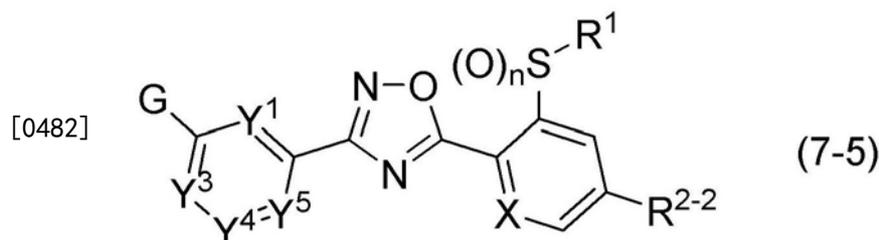
[0477] 所示的化合物中, X为N, R²⁻²为H, R¹、n、Y¹、Y³、Y⁴、Y⁵和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0478] 式(7-4)所示的化合物中, X为N, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Y¹、Y³、Y⁴、Y⁵和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0479] 式(7-4)所示的化合物中,X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0480] 式(7-4)所示的化合物中,X为CH, R^{2-2} 为CF₃, R^1 、n、 Y^1 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0481] 式(7-5)



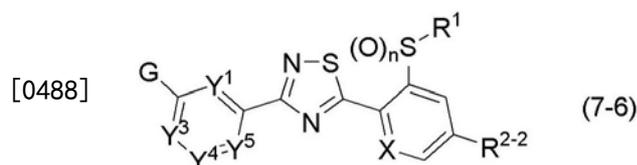
[0483] 所示的化合物中,X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0484] 式(7-5)所示的化合物中,X为N, R^{2-2} 为CF₃, R^1 、n、 Y^1 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0485] 式(7-5)所示的化合物中,X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0486] 式(7-5)所示的化合物中,X为CH, R^{2-2} 为CF₃, R^1 、n、 Y^1 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0487] 式(7-6)



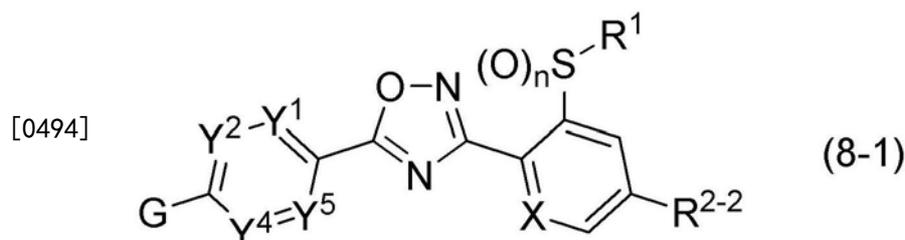
[0489] 所示的化合物中,X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0490] 式(7-6)所示的化合物中,X为N, R^{2-2} 为CF₃, R^1 、n、 Y^1 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0491] 式(7-6)所示的化合物中,X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0492] 式(7-6)所示的化合物中,X为CH, R^{2-2} 为CF₃, R^1 、n、 Y^1 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表E]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0493] 式(8-1)



[0495] 所示的化合物中,X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表F]中记载的任一组合的

本发明化合物。

[0496] [表F]

[0497]

R ¹	n	Y ¹	Y ²	Y ⁴	Y ⁵	G
CH ₂ CH ₃	2	N	CH	CH	CH	CF ₃
CH ₂ CH ₃	2	CH	N	CH	CH	CF ₃
CH ₂ CH ₃	2	N	N	CH	CH	CF ₃
CH ₂ CH ₃	2	N	CH	N	CH	CF ₃
CH ₂ CH ₃	2	CH	N	N	CH	CF ₃
CH ₂ CH ₃	2	N	CH	CH	N	CF ₃

[0498] 式(8-1)所示的化合物中,X为N,R²⁻²为CF₃,R¹、n、Y¹、Y²、Y⁴、Y⁵和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0499] 式(8-1)所示的化合物中,X为CH,R²⁻²为H,R¹、n、Y¹、Y²、Y⁴、Y⁵和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0500] 式(8-1)所示的化合物中,X为CH,R²⁻²为CF₃,R¹、n、Y¹、Y²、Y⁴、Y⁵和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0501] 式(8-2)

[0502]



[0503] 所示的化合物中,X为N,R²⁻²为H,R¹、n、Y¹、Y²、Y⁴、Y⁵和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

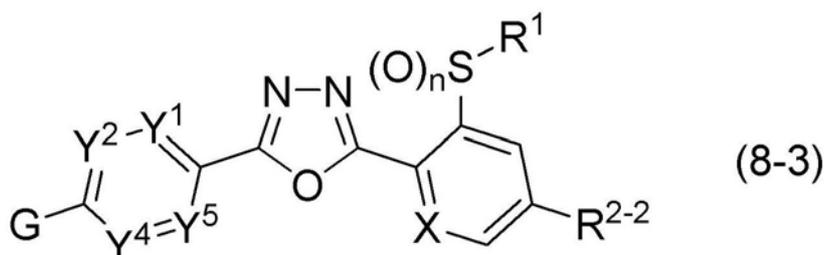
[0504] 式(8-2)所示的化合物中,X为N,R²⁻²为CF₃,R¹、n、Y¹、Y²、Y⁴、Y⁵和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0505] 式(8-2)所示的化合物中,X为CH,R²⁻²为H,R¹、n、Y¹、Y²、Y⁴、Y⁵和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0506] 式(8-2)所示的化合物中,X为CH,R²⁻²为CF₃,R¹、n、Y¹、Y²、Y⁴、Y⁵和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0507] 式(8-3)

[0508]



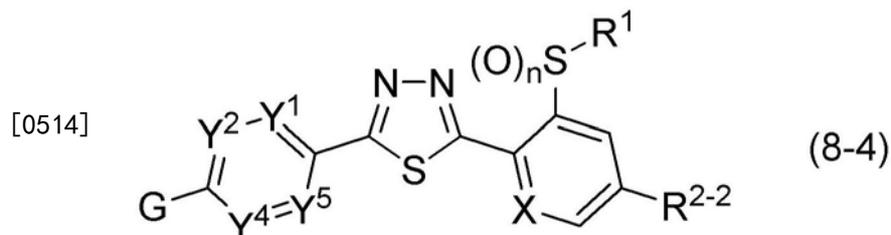
[0509] 所示的化合物中,X为N,R²⁻²为H,R¹、n、Y¹、Y²、Y⁴、Y⁵和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0510] 式(8-3)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0511] 式(8-3)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0512] 式(8-3)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0513] 式(8-4)



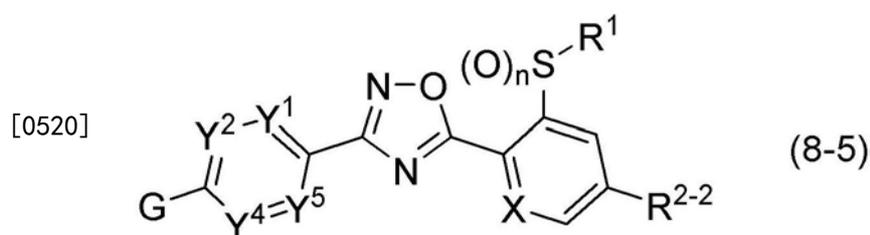
[0515] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0516] 式(8-4)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0517] 式(8-4)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0518] 式(8-4)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0519] 式(8-5)



[0521] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

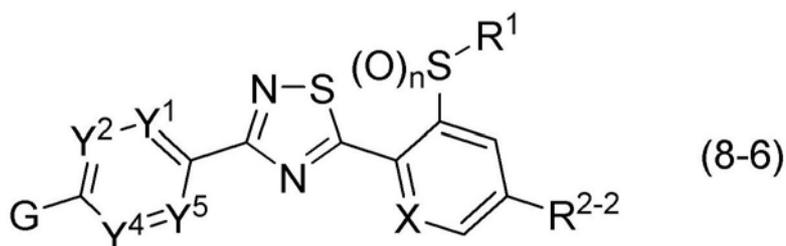
[0522] 式(8-5)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0523] 式(8-5)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0524] 式(8-5)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0525] 式(8-6)

[0526]



[0527] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

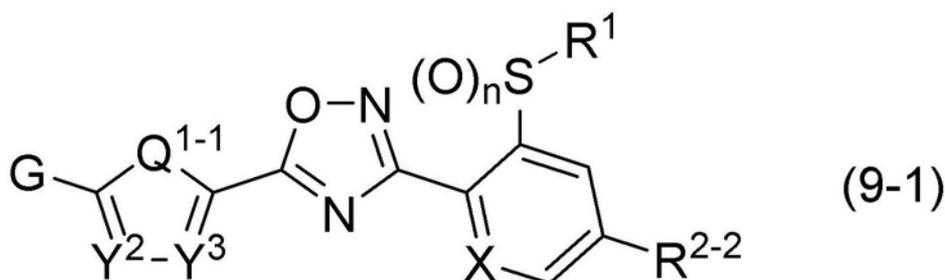
[0528] 式(8-6)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0529] 式(8-6)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0530] 式(8-6)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^4 、 Y^5 和G为[表F]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0531] 式(9-1)

[0532]



[0533] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Q^{1-1} 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0534] [表G]

[0535]

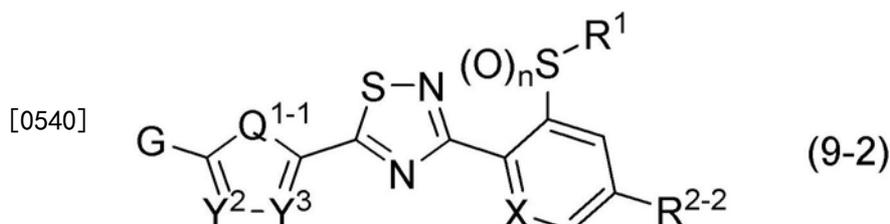
R^1	n	Q^{1-1}	Y^2	Y^3	G
CH_2CH_3	2	0	CH	CH	CF_3
CH_2CH_3	2	S	CH	CH	CF_3
CH_2CH_3	2	NCH_3	CH	CH	CF_3

[0536] 式(9-1)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Q^{1-1} 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0537] 式(9-1)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Q^{1-1} 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0538] 式(9-1)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Q^{1-1} 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0539] 式(9-2)



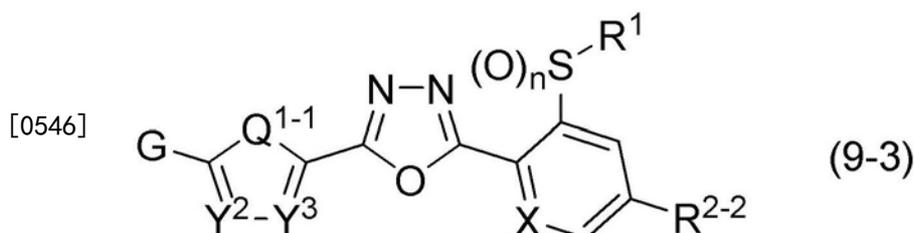
[0541] 所示的化合物中, X为N, R²⁻²为H, R¹、n、Q¹⁻¹、Y²、Y³和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0542] 式(9-2)所示的化合物中, X为N, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Q¹⁻¹、Y²、Y³和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0543] 式(9-2)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为H, R¹、n、Q¹⁻¹、Y²、Y³和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0544] 式(9-2)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Q¹⁻¹、Y²、Y³和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0545] 式(9-3)



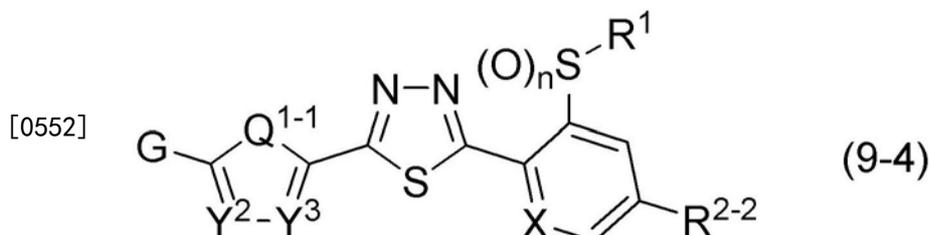
[0547] 所示的化合物中, X为N, R²⁻²为H, R¹、n、Q¹⁻¹、Y²、Y³和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0548] 式(9-3)所示的化合物中, X为N, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Q¹⁻¹、Y²、Y³和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0549] 式(9-3)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为H, R¹、n、Q¹⁻¹、Y²、Y³和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0550] 式(9-3)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Q¹⁻¹、Y²、Y³和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0551] 式(9-4)



[0553] 所示的化合物中, X为N, R²⁻²为H, R¹、n、Q¹⁻¹、Y²、Y³和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

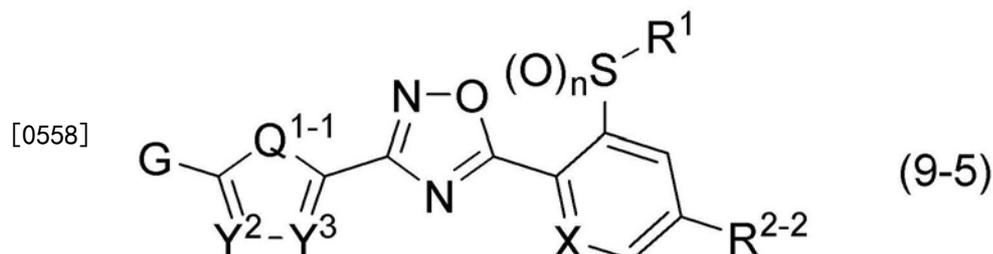
[0554] 式(9-4)所示的化合物中, X为N, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Q¹⁻¹、Y²、Y³和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0555] 式(9-4)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为H, R¹、n、Q¹⁻¹、Y²、Y³和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

一组合的本发明化合物。

[0556] 式(9-4)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、 n 、 Q^{1-1} 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0557] 式(9-5)



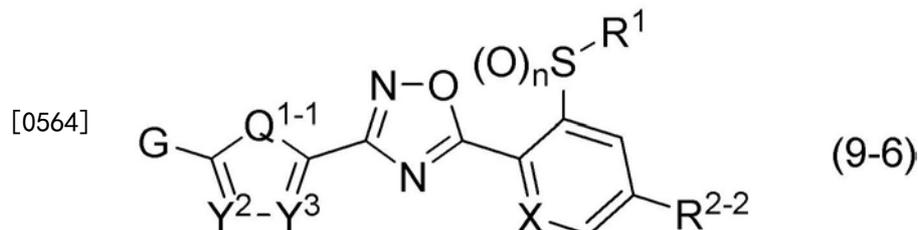
[0559] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、 n 、 Q^{1-1} 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0560] 式(9-5)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、 n 、 Q^{1-1} 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0561] 式(9-5)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、 n 、 Q^{1-1} 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0562] 式(9-5)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、 n 、 Q^{1-1} 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0563] 式(9-6)



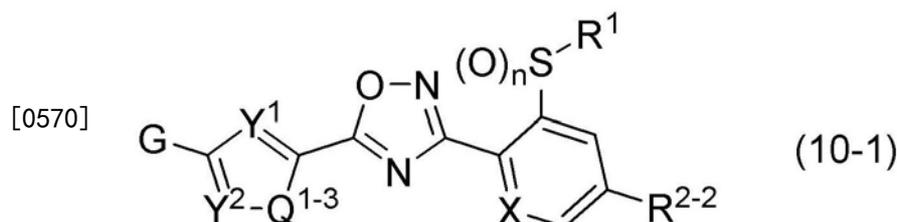
[0565] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、 n 、 Q^{1-1} 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0566] 式(9-6)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、 n 、 Q^{1-1} 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0567] 式(9-6)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、 n 、 Q^{1-1} 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0568] 式(9-6)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、 n 、 Q^{1-1} 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表G]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0569] 式(10-1)



[0571] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、 n 、 Q^{1-3} 、 Y^1 、 Y^2 和G为[表H]中记载的任一组合的

本发明化合物。

[0572] [表H]

[0573]

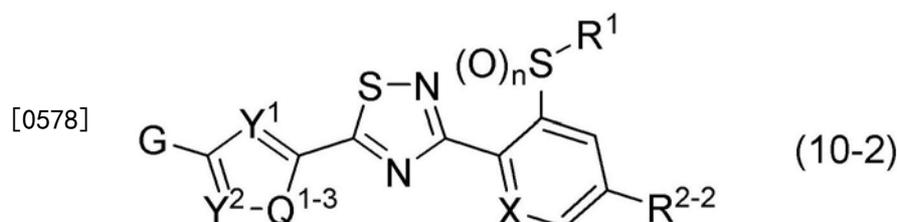
R ¹	n	Q ¹⁻³	Y ¹	Y ²	G
CH ₂ CH ₃	2	S	N	H	CF ₃
CH ₂ CH ₃	2	O	N	H	CF ₃
CH ₂ CH ₃	2	NCH ₃	N	H	CF ₃
CH ₂ CH ₃	2	NCH ₃	CH	N	CF ₃

[0574] 式(10-1)所示的化合物中, X为N, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Q¹⁻³、Y¹、Y²和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0575] 式(10-1)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为H, R¹、n、Q¹⁻³、Y¹、Y²和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0576] 式(10-1)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Q¹⁻³、Y¹、Y²和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0577] 式(10-2)



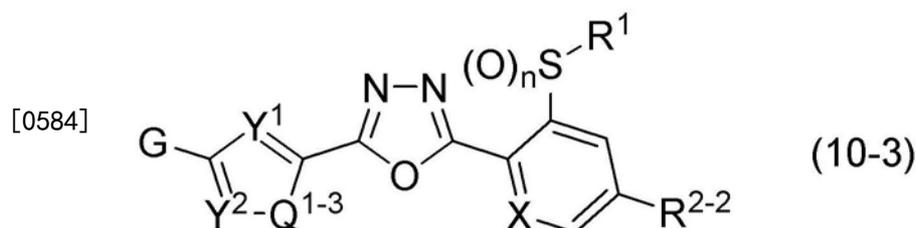
[0579] 所示的化合物中, X为N, R²⁻²为H, R¹、n、Q¹⁻³、Y¹、Y²和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0580] 式(10-2)所示的化合物中, X为N, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Q¹⁻³、Y¹、Y²和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0581] 式(10-2)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为H, R¹、n、Q¹⁻³、Y¹、Y²和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0582] 式(10-2)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Q¹⁻³、Y¹、Y²和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0583] 式(10-3)



[0585] 所示的化合物中, X为N, R²⁻²为H, R¹、n、Q¹⁻³、Y¹、Y²和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

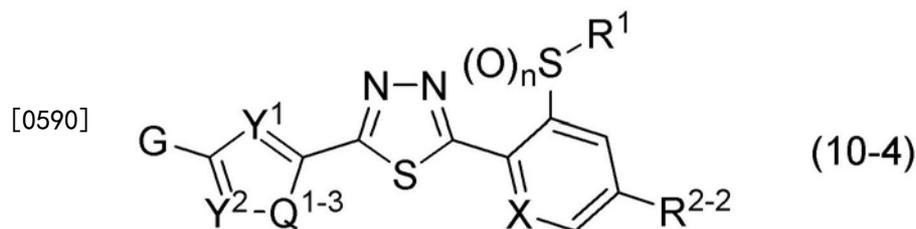
[0586] 式(10-3)所示的化合物中, X为N, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Q¹⁻³、Y¹、Y²和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0587] 式(10-3)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为H, R¹、n、Q¹⁻³、Y¹、Y²和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

一组合的本发明化合物。

[0588] 式(10-3)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、 n 、 Q^{1-3} 、 Y^1 、 Y^2 和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0589] 式(10-4)



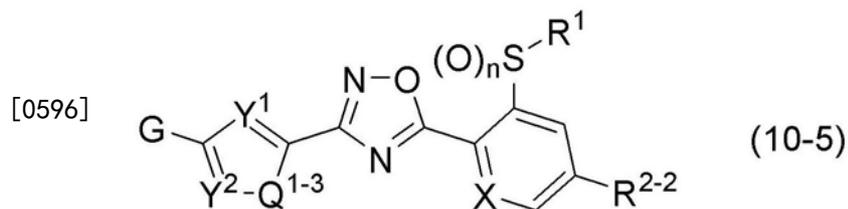
[0591] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、 n 、 Q^{1-3} 、 Y^1 、 Y^2 和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0592] 式(10-4)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、 n 、 Q^{1-3} 、 Y^1 、 Y^2 和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0593] 式(10-4)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、 n 、 Q^{1-3} 、 Y^1 、 Y^2 和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0594] 式(10-4)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、 n 、 Q^{1-3} 、 Y^1 、 Y^2 和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0595] 式(10-5)



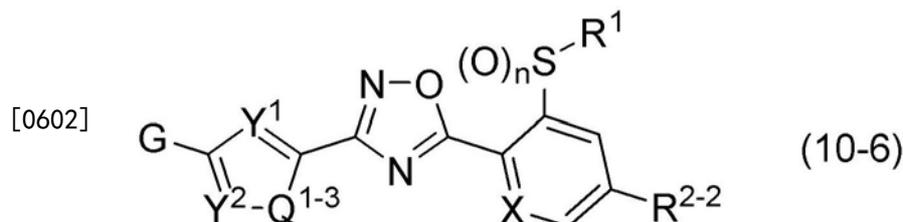
[0597] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、 n 、 Q^{1-3} 、 Y^1 、 Y^2 和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0598] 式(10-5)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、 n 、 Q^{1-3} 、 Y^1 、 Y^2 和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0599] 式(10-5)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、 n 、 Q^{1-3} 、 Y^1 、 Y^2 和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0600] 式(10-5)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、 n 、 Q^{1-3} 、 Y^1 、 Y^2 和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0601] 式(10-6)



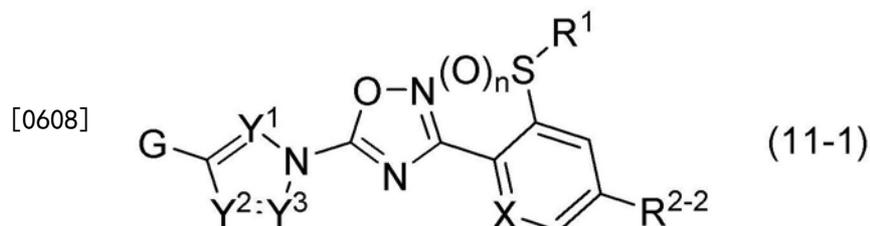
[0603] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、 n 、 Q^{1-3} 、 Y^1 、 Y^2 和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0604] 式(10-6)所示的化合物中,X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Q^{1-3} 、 Y^1 、 Y^2 和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0605] 式(10-6)所示的化合物中,X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Q^{1-3} 、 Y^1 、 Y^2 和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0606] 式(10-6)所示的化合物中,X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Q^{1-3} 、 Y^1 、 Y^2 和G为[表H]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0607] 式(11-1)



[0609] 所示的化合物中,X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0610] [表I]

[0611]

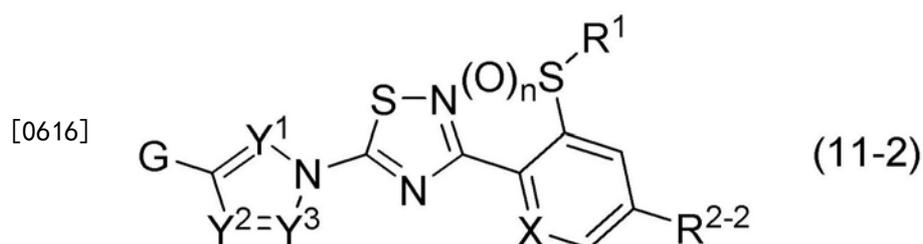
R^1	n	Y^1	Y^2	Y^3	G
CH_2CH_3	2	CH	CH	CH	CF_3
CH_2CH_3	2	N	CH	CH	CF_3
CH_2CH_3	2	N	CH	CH	CF_3CF_2
CH_2CH_3	2	N	CCl	CH	CF_3
CH_2CH_3	2	N	CBr	CH	CF_3
CH_2CH_3	2	CH	N	CH	CF_3
CH_2CH_3	2	N	N	CH	CF_3
CH_2CH_3	2	N	CH	N	CF_3
CH_2CH_3	2	CH	N	N	CF_3

[0612] 式(11-1)所示的化合物中,X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0613] 式(11-1)所示的化合物中,X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0614] 式(11-1)所示的化合物中,X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0615] 式(11-2)



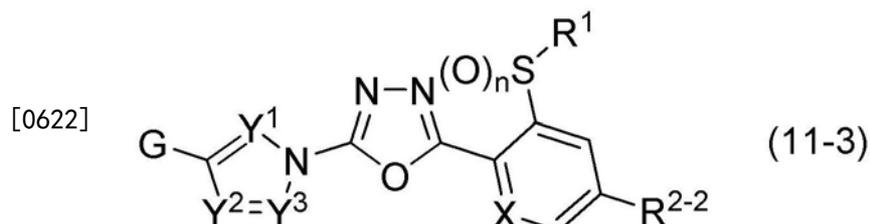
[0617] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0618] 式(11-2)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0619] 式(11-2)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0620] 式(11-2)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0621] 式(11-3)



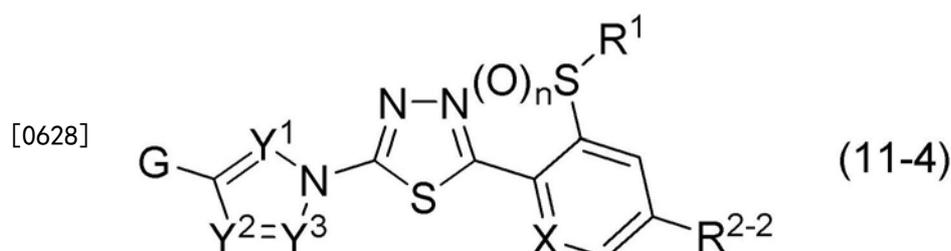
[0623] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0624] 式(11-3)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0625] 式(11-3)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0626] 式(11-3)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0627] 式(11-4)



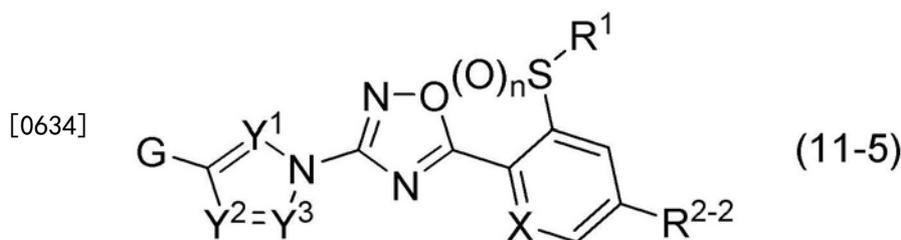
[0629] 所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0630] 式(11-4)所示的化合物中, X为N, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0631] 式(11-4)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为H, R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0632] 式(11-4)所示的化合物中, X为CH, R^{2-2} 为 CF_3 , R^1 、n、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0633] 式(11-5)



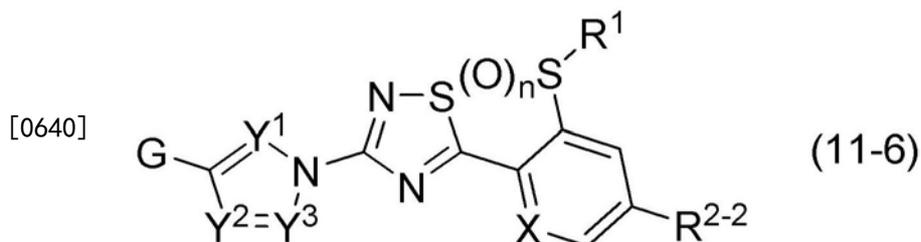
[0635] 所示的化合物中, X为N, R²⁻²为H, R¹、n、Y¹、Y²、Y³和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0636] 式(11-5)所示的化合物中, X为N, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Y¹、Y²、Y³和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0637] 式(11-5)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为H, R¹、n、Y¹、Y²、Y³和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0638] 式(11-5)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Y¹、Y²、Y³和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0639] 式(11-6)



[0641] 所示的化合物中, X为N, R²⁻²为H, R¹、n、Y¹、Y²、Y³和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0642] 式(11-6)所示的化合物中, X为N, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Y¹、Y²、Y³和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0643] 式(11-6)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为H, R¹、n、Y¹、Y²、Y³和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0644] 式(11-6)所示的化合物中, X为CH, R²⁻²为CF₃, R¹、n、Y¹、Y²、Y³和G为[表I]中记载的任一组合的本发明化合物。

[0645] 作为本发明防除剂具有效力的有害节肢动物, 例如可举出昆虫纲类、蜘蛛纲类、唇脚纲类、倍脚纲类、软甲纲类、腹足纲类等。作为有害昆虫纲类, 例如可举出半翅目害虫、鳞翅目害虫、缨翅目害虫、双翅目害虫、鞘翅目害虫、直翅目害虫、隐翅目害虫、虱毛目害虫、咬虱目害虫、膜翅目害虫、蟑螂目害虫、白蚁目害虫等。作为蜘蛛纲类, 例如可举出蜘蛛目害虫、螨虫目害虫等。作为所述有害节肢动物, 具体地例如可举出以下的害虫。

[0646] 半翅目害虫: 灰飞虱 (*Laodelphax striatella*)、褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*)、白背飞虱 (*Sogatella furcifera*) 等飞虱类; 黑尾叶蝉 (*Nephotettix cincticeps*)、二点黑尾叶蝉 (*Nephotettix virescens*)、小绿叶蝉 (*Empoasca onukii*) 等叶蝉类; 棉蚜 (*Aphis gossypii*)、桃蚜 (*Myzus persicae*)、甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*)、绣线菊蚜 (*Aphis spiraeicola*)、马铃薯长管蚜 (*Macrosiphum euphorbiae*)、茄沟无网蚜 (*Aulacorthum solani*)、禾谷缢管蚜 (*Rhopalosiphum padi*)、桔蚜 (*Toxoptera citricidus*)、桃粉大尾蚜

(*Hyalopterus pruni*) 等蚜虫类; 稻绿椿 (*Nezara antennata*)、豆蜂缘椿 (*Riptortus clavetus*)、华稻缘椿 (*Leptocoris chinensis*)、尖角二星椿 (*Eysarcoris parvus*)、茶翅椿象 (*Halyomorpha mista*) 等椿类; 白粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*)、烟粉虱 (*Bemisia tabaci*)、柑橘粉虱 (*Dialeurodes citri*)、黑刺粉虱 (*Aleurocanthus spiniferus*) 等粉虱类; 红圆蚧 (*Aonidiella aurantii*)、梨圆蚧总科 (*Comstockaspis perniciosus*)、桔矢尖蚧 (*Unaspis citri*)、红蜡蚧 (*Ceroplastes rubens*)、吹绵蚧 (*Icerya purchasi*)、紫藤臀纹粉蚧 (*Planococcus kraunhiae*)、长尾粉蚧 (*Pseudococcus longispinis*)、桑白蚧 (*Pseudaulacaspis pentagona*) 等蚧总科类; 网椿类; 温带臭虫 (*Cimex lectularius*) 等臭虫类及木虱类。

[0647] 鳞翅目害虫: 水稻二化螟虫 (*Chilo suppressalis*)、三化螟 (*Tryporyza incertulas*)、稻纵卷叶螟 (*Cnaphalocrocis medinalis*)、棉大卷叶野螟 (*Notarcha derogata*)、印度谷斑螟 (*Plodia interpunctella*)、亚洲玉米螟 (*Ostrinia furnacalis*)、菜螟 (*Hellula undalis*)、早熟禾草螟 (*Pediasia tetterellus*) 等螟蛾类; 斜纹夜盗虫 (*Spodoptera litura*)、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua*)、东方粘虫 (*Pseudaletia separata*)、甘蓝夜蛾 (*Mamestra brassicae*)、小地老虎 (*Agrotis ipsilon*)、显银纹夜蛾 (*Plusia nigrisigna*)、粉纹夜蛾属、实夜蛾 (*Heliothis*) 属、棉铃虫 (*Helicoverpa*) 属等夜蛾类; 菜粉蝶 (*Pieris rapae*) 等粉蝶类; 褐带卷蛾属、梨小食心虫 (*Grapholita molesta*)、大豆食心虫 (*Leguminivora glycinivorella*)、日豆小卷蛾 (*Matsumuraeses azukivora*)、苹果卷蛾 (*Adoxophyes orana fasciata*)、茶小卷叶蛾 (*Adoxophyes honmai.*)、茶长卷蛾 (*Homona magnanima*)、苹果黄卷蛾 (*Archips fuscocupreanus*)、苹果蠹蛾 (*Cydia pomonella*) 等蚜虫类; 茶细蛾 (*Caloptilia theivora*)、金纹小潜细蛾 (*Phyllonorycter ringoneella*) 的细蛾类、桃小食心虫 (*Carposina niponensis*) 等蛀果蛾类; 潜蛾 (*Lyonetia*) 属等潜叶蛾类; 毒蛾属; 黄毒蛾 (*Euproctis*) 属等毒蛾类; 小菜蛾 (*Plutella xylostella*) 等 Yponomeutinae 类; 红铃虫 (*Pectinophora gossypiella*)、马铃薯块茎蛾 (*Phthorimaea operculella*) 等麦蛾类; 美洲白蛾 (*Hyphantria cunea*) 等灯蛾类及衣蛾 (*Tinea translucens*)、幕谷蛾 (*Tineola bisselliella*) 等谷蛾类。

[0648] 缨翅目害虫: 西花蓟马 (*Frankliniella occidentalis*)、南黄蓟马 (*Thrips parvi*)、小黄蓟马 (*Scirtothrips dorsalis*)、烟蓟马 (*Thrips tabaci*)、花蓟马 (*Frankliniella intonsa*) 等蓟马类。

[0649] 双翅目害虫: 淡色库蚊 (*Culex pipiens pallens*)、三带喙库蚊 (*Culex tritaeniorhynchus*)、致倦库蚊 (*Culex quinquefasciatus*) 等库蚊类; 埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*)、白纹伊蚊 (*Aedes albopictus*) 等伊蚊属; 中华按蚊 (*Anopheles sinensis*) 等疟蚊属; 摇蚊类、家蝇 (*Musca domestica*)、厩腐蝇 (*Muscina stabulans*) 等家蝇类; 绿头苍蝇类、食肉蝇类、夏厕蝇类、灰地种蝇 (*Delia platura*)、葱蝇 (*Delia antiqua*) 等花蝇类; 日本稻潜蝇 (*Agromyza oryzae*)、稻潜叶蝇 (*Hydrellia griseola*)、美洲斑潜蝇 (トマトハモグリバ工, *Liriomyza sativae*)、三叶斑潜蝇 (*Liriomyza trifolii*)、豌豆彩潜蝇 (*Chromatomyia horticola*) 等潜蝇类; 稻秆蝇 (*Chlorops oryzae*) 等秆蝇类; 瓜大实蝇 (*Dacus cucurbitae*)、地中海实蝇 (*Ceratitis capitata*) 等实蝇类; 果蝇类、东亚异蚤蝇 (*Megaselia spiracularis*) 等菇蝇类; 毛蠓 (*Clogmia albipunctata*) 等蝶蝇类; 黑翅蕈蚋

类、黑蝇类、马蝇 (*Tabanus trigonus*) 等虻类; 虱蝇属类及厩螫蝇类。

[0650] 鞘翅目害虫: 玉米根虫 (*Diabrotica virgifera virgifera*)、十一星根萤叶甲 (*Diabrotica undecimpunctata howardi*) 等玉米根虫类; 铜绿异丽金龟 (*Anomala cuprea*)、红铜丽金龟 (*Anomala rufocuprea*)、日本金龟子 (*Popillia japonica*) 等金龟子类; 玉米象 (*Sitophilus zeamais*)、稻水象甲 (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、绿豆象 (*Callosobruchus chinensis*)、稻象甲 (*Echinocnemus squameus*)、墨西哥棉铃象 (*Anthonomus grandis*)、芝草害虫 (*Sphenophorus venatus*) 等象鼻虫类; 黄粉虫 (*Tenebrio molitor*)、赤拟谷盗 (*Tribolium castaneum*) 等拟步甲类; 水稻负泥虫 (*Oulema oryzae*)、黄守瓜 (*Aulacophora femoralis*)、黄曲条跳甲 (*Phyllotreta striolata*)、马铃薯叶甲 (*Leptinotarsa decemlineata*) 等金花虫类; 小圆皮蠹 (*Anthrenus verbasci*)、白腹皮蠹 (*Dermestes maculatus*) 等皮蠹类; 烟草甲 (*Lasioderma serricornis*) 等窃蠹类; 二十八星瓢虫 (*Epilachna vigintioctopunctata*) 等植食瓢虫类; 褐粉蠹 (*Lyctus brunneus*)、纵坑切梢小蠹 (*Tomicus piniperda*) 等蛀木水虱类; 长蠹类、蛛甲类、星天牛 (*Anoplophora malasiaca*) 等天牛类; 金针虫类 (*Agriotes* spp.) 及隐翅虫 (*Paederus fuscipes*)。

[0651] 直翅目害虫: 东亚飞蝗 (*Locusta migratoria*)、非洲蝼蛄 (*Gryllotalpa africana*)、小翅稻蝗 (*Oxya yezoensis*)、日本稻蝗 (*Oxya japonica*) 及蟋蟀类。

[0652] 隐翅目害虫: 栉头蚤 (*Ctenocephalides felis*)、狗跳蚤 (*Ctenocephalides canis*)、致痒蚤 (*Pulex irritans*)、印度鼠蚤 (*Xenopsylla cheopis*) 等。

[0653] 虱毛目害虫: 人体虱 (*Pediculus humanus corporis*)、头虱 (*Pediculus humanus humanus*)、阴虱 (*Phthirus pubis*)、牛血虱 (*Haematopinus eurysternus*)、羊血虱 (*Dalmalinia ovis*)、猪血虱 (*Haematopinus suis*)、犬颚虱 (*Linognathus setosus*) 等。

[0654] 咬虱目害虫: 羊毛虱 (*Dalmalinia ovis*)、牛毛虱 (*Dalmalinia bovis*)、鸡羽虱 (*Menopon gallinae*)、狗毛虱 (*Trichodectes canis*)、猫毛虱 (*Felicola subrostrata*) 等。

[0655] 膜翅目害虫: 法老蚁 (*Monomorium pharaonis*)、丝光褐林蚁 (*Formica fusca japonica*)、光滑管琉璃蚁 (*Ochetellus glaber*)、双针棱胸切叶蚁 (*Pristomyrmex pungens*)、宽节大头蚁 (*Pheidole noda*)、顶端切叶蚁属 (*Acromyrmex* spp.)、火蚁属 (*Solenopsis* spp.)、阿根廷蚁 (*Linepithema humile*) 等蚁类; 大黄蜂类; 肿腿蜂类及黄翅菜叶蜂 (*Athalia rosae*)、日本菜叶蜂 (*Athalia japonica*) 等叶蜂类。

[0656] 蟑螂目害虫: 德国小蠊 (*Blattella germanica*)、黑胸大蠊 (*Periplaneta fuliginosa*)、美洲大蠊 (*Periplaneta americana*)、棕色蟑螂 (*Periplaneta brunnea*)、东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*)。

[0657] 白蚁目害虫: 黄胸散白蚁 (*Reticulitermes speratus*)、家白蚁 (*Coptotermes formosanus*)、如小楹白蚁 (*Incisitermes minor*)、截头堆砂白蚁 (*Cryptotermes domesticus*)、黑翅土白蚁 (*Odontotermes formosanus*)、恒春新白蚁 (*Neotermes koshunensis*)、赤树白蚁 (*Glyptotermes satsumensis*)、中岛白蚁 (*Glyptotermes nakajimai*)、黑树白蚁 (*Glyptotermes fuscus*)、儿玉白蚁 (*Glyptotermes kodamai*)、串本白蚁 (*Glyptotermes kushimensis*)、日本原白蚁 (*Hodotermopsis japonica*)、广州家白蚁 (*Coptotermes guangzhouensis*)、奄美散白蚁 (*Reticulitermes miyatakei*)、黄肢散白蚁 (*Reticulitermes flaviceps amamianus*)、轩白蚁 (*Reticulitermes* sp.)、高山象白蚁

(*Nasutitermes takasagoensis*)、近扭白蚁(*Pericapritermes nitobei*)及台湾华扭白蚁(*Sinocapritermes mushae*)等。

[0658] 螨虫目害虫:二斑叶螨(*Tetranychus urticae*)、神泽叶螨(*Tetranychus kanzawai*)、全爪螨(*Panonychus citri*)、苹果全爪螨(*Panonychus ulmi*)、小爪螨属等叶螨类;桔刺皮瘿螨(*Aculops pelekassi*)、琉球柑橘铁壁虱(*Phyllocoptruta citri*)、番茄刺皮瘿螨(*Aculops lycopersici*)、茶叶瘿螨(*Calacarus carinatus*)、茶尖叶瘿螨(*Acaphylla theavagrans*)、伪梨瘿螨(*Eriophyes chibaensis*)、苹果瘿螨(*Aculus schlehtendali*)等瘿螨类;侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonemus latus*)等似虱螨类;紫红短须螨(*Brevipalpus phoenicis*)等细须螨类;杜克螨类、长角血蜱(*Haemaphysalis longicornis*)、褐黄血蜱(*Haemaphysalis flava*)、台湾矩头蜱(*Dermacentor taiwanicus*)、变异矩头蜱(*Dermacentor variabilis*)、卵形硬蜱(*Ixodes ovatus*)、全沟血蜱(*Ixodes persulcatus*)、肩突硬蜱(*Ixodes scapularis*)、美洲花蜱(*Amblyomma americanum*)、微小牛蜱(*Boophilus microplus*)、血红扇头蜱(*Rhipicephalus sanguineus*)等硬蜱类;腐食酪螨(*Tyrophagus putrescentiae*)、似食酪螨(*Tyrophagus similis*)等粉螨类;粉尘螨(*Dermatophagoides farinae*)、欧洲家刺螨(*Dermatophagoides ptrehyssnus*)等尘螨类;普通肉食螨(*Cheyletus eruditus*)、马六甲肉食螨(*Cheyletus malaccensis*)、湄南肉食螨(*Cheyletus moorei*)、犬肉食螨(*Cheyletiella yasguri*)等肉食螨类;耳痒螨(*Octodectes cynotis*)、疥螨(*Sarcoptes scabiei*)等疥螨类;犬蠕形螨(*Demodex canis*)等毛囊螨类;囊凸牦螨类、若甲螨类、柏氏禽刺螨(*Ornithonyssus bacoti*)、林禽刺螨(*Ornithonyssus sylvairum*)、鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*)等鸡螨类;纤恙螨红虫(*Leptotrombidium akamushi*)等恙螨类等。

[0659] 蜘蛛目害虫:日本红螯蛛(*Chiracanthium japonicum*)、红背蜘蛛(*Latrodectus hasseltii*)等。

[0660] 唇足纲类、蚰蜒目害虫:蚰蜒(*Thereuonema hilgendorfi*)等、蜈蚣目害虫:少棘蜈蚣(*Scolopendra subspinipes*)等。

[0661] 倍足纲类、马陆目害虫:温室马陆(*Oxidus gracilis*)、赤马陆(*Nedyopus tambanus*)等。

[0662] 软甲纲类、等脚目类:鼠妇(*Armadillidium vulgare*)等。

[0663] 腹足纲类、柄眼目害虫:茶甲罗蛞蝓(*Limax marginatus*)、黄蛞蝓(*Limax flavus*)等。

[0664] 本发明防除剂含有本化合物和惰性载体。

[0665] 本发明中,惰性载体是指固体载体、液体载体和气体状载体。本发明防除剂通常将本化合物和惰性载体混合,根据需要添加表面活性剂、其他制剂用辅助剂,制剂化为乳剂、油剂、粉剂、粒剂、水合剂、流动剂、微胶囊剂、气溶胶剂、发烟剂、毒饵剂、树脂制剂、洗发剂、膏状制剂、泡沫剂、二氧化碳制剂、片剂等。这些制剂有时也加工为蚊香、电热驱蚊片、液体驱蚊制剂、发烟剂、烟熏剂、片状制剂、喷滴制剂(spot on agent)、经口处理剂而使用。

[0666] 本发明防除剂通常含有0.01~95重量%本化合物。

[0667] 作为在制剂化时使用的固体载体,可举出例如粘土类(高岭土、硅藻土、膨润土、Fubasami粘土、酸性白土等)、合成含水氧化硅、滑石、陶瓷、其他无机矿物(丝云母、石英、

硫、活性碳、碳酸钙、水合二氧化硅等)、化学肥料(硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、尿素、氯化铵等)等微粉及粒状物等、以及合成树脂(聚丙烯、聚丙烯腈、聚甲基丙烯酸甲酯、聚对苯二甲酸乙二醇酯等聚酯树脂;尼龙-6、尼龙-11、尼龙-66等尼龙树脂;聚酰胺树脂、聚氯乙烯、聚偏二氯乙烯、氯乙烯-丙烯共聚物等)。

[0668] 作为液体载体,可举出例如水、醇类(甲醇、乙醇、异丙醇、丁醇、己醇、苄醇、乙二醇、丙二醇、苯氧基乙醇等)、酮类(丙酮、甲乙酮、环己酮等)、芳香族烃类(甲苯、二甲苯、乙苯、十二烷基苯、苯基二甲苯基乙烷、甲基萘等)、脂肪族烃类(己烷、环己烷、煤油、轻油等)、酯类(乙酸乙酯、乙酸丁酯、肉豆蔻酸异丙酯、油酸乙酯、己二酸二异丙酯、己二酸二异丁酯、丙二醇单甲醚乙酸酯等)、腈类(乙腈、异丁腈等)、醚类(二异丙醚、1,4-二噁烷、乙二醇二甲醚、二乙二醇二甲醚、二乙二醇单甲醚、丙二醇单甲醚、二丙二醇单甲醚、3-甲氧基-3-甲基-1-丁醇等)、酰胺类(N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等)、卤代烃类(二氯甲烷、三氯乙烷、四氯化碳等)、亚砷类(二甲基亚砷等)、碳酸亚丙酯及植物油(大豆油、棉籽油等)。

[0669] 作为气体状载体,可举出例如碳氟化合物、丁烷气体、LPG(液化石油气体)、甲醚及二氧化碳。

[0670] 作为表面活性剂,可举出例如聚氧亚乙基烷基醚、聚氧亚乙基烷基芳基醚、聚乙二醇脂肪酸酯等非离子表面活性剂、及烷基磺酸盐、烷基苯磺酸盐、烷基硫酸盐等阴离子表面活性剂。

[0671] 作为其他制剂用辅助剂,可举出固着剂、分散剂、着色剂及稳定剂等,可具体举出例如酪蛋白、明胶、糖类(淀粉、阿拉伯胶、纤维素衍生物、海藻酸等)、木质素衍生物、膨润土、合成水溶性高分子(聚乙烯醇、聚乙烯吡咯烷酮、聚丙烯酸类等)、PAP(酸性磷酸异丙酯)、BHT(2,6-二叔丁基-4-甲基苯酚)、BHA(2-叔丁基-4-甲氧基苯酚与3-叔丁基-4-甲氧基苯酚的混合物)。

[0672] 作为树脂制剂的基材,可举例如氯乙烯系聚合物、聚氨酯等,可以根据需要在这些基材中添加邻苯二甲酸酯类(邻苯二甲酸二甲酯、邻苯二甲酸二辛酯等)、己二酸酯类、硬脂酸等增塑剂。在该基材中用通常的混炼装置将化合物混炼后,通过注射成型、挤出成型、冲压成型等进行成型而得到树脂制剂,可以根据需要进一步经过成型、裁切等工序,加工为板状、膜状、带状、网状、绳状等的树脂制剂。这些树脂制剂可以加工为例如动物用项圈、动物用耳标、片状制剂、诱捕绳、园艺用支柱。

[0673] 作为毒饵的基材,可举出例如谷物粉、植物油、糖、结晶纤维素等,可进一步根据需要添加二丁基羟基甲苯、去甲二氢愈创木酸(ノルジヒドロゲアイアレチン酸)等抗氧化剂;脱氢乙酸等防腐剂;辣椒末等针对小孩、宠物的防误食剂;奶酪香料、洋葱香料、花生油等害虫诱捕性香料等。

[0674] 通过将本化合物的有效量向有害节肢动物直接和/或向有害节肢动物的栖息场所(植物、土壤、房屋内、动物体等)施用来进行本发明的有害节肢动物防除方法。在本发明的有害节肢动物防除方法中,通常以本发明防除剂的形态使用。

[0675] 将本发明防除剂用于农业领域的有害节肢动物防除时,其施用量通常每10000m²本化合物量为1~10000g。将本发明防除剂制剂化为乳剂、水合剂、流动剂等时,通常,以有效成分浓度为0.01~10000ppm的方式用水稀释后施用,粒剂、粉剂等通常直接施用。

[0676] 可将这些制剂、制剂的水稀释液对有害节肢动物或为了避免有害节肢动物的危害

而需要保护的作物等植物直接进行喷洒处理,另外也可以为了防除在耕地的土壤中生存的有害节肢动物而对该土壤进行处理。

[0677] 另外,也可以通过将加工为片状、绳状的树脂制剂缠绕于作物、在作物旁边拉伸、铺在植株根部土壤等方法进行处理。

[0678] 将本发明防除剂用于生存在房屋内的有害节肢动物的防除时,其施用量在对面上进行处理时通常为每处理面积 1m^2 的本化合物量 $0.01\sim 1000\text{mg}$,对空间进行处理时每处理空间 1m^3 的本化合物量通常为 $0.01\sim 500\text{mg}$ 。将本发明防除剂制剂化为乳剂、水合剂、流动剂等时,通常以有效成分浓度为 $0.1\sim 10000\text{ppm}$ 的方式用水稀释后施用,油剂、气溶胶剂、发烟剂、毒饵剂等直接施用。

[0679] 将本发明的有害节肢动物防除剂用于牛、马、猪、羊、山羊、鸡用的家畜;狗、猫、大鼠、小鼠等小动物的外部寄生虫防除时,可以通过兽医学的公知的方法对动物使用。作为具体的使用方法,以全身抑制为目的时,例如通过片剂、饲料混入、栓剂、注射(肌肉内、皮下、静脉内、腹腔内等)来给药,以非全身的抑制为目的时,例如通过进行将油剂或水性液剂喷雾的浇泼处理或喷滴处理、用洗发制剂清洗动物或将树脂制剂制成项圈、耳札并带在动物上等方法来使用。对动物体给药时的本化合物的量相对于通常动物的体重 1kg 在 $0.1\sim 1000\text{mg}$ 的范围内。

[0680] 可以在栽培有下述“作物”的农业用土地使用本发明防除剂。

[0681] 农作物:玉米、稻、小麦、大麦、黑麦、燕麦、高粱、棉花、大豆、花生、荞麦、甜菜、油菜籽、向日葵、甘蔗、烟草等。

[0682] 蔬菜:茄科蔬菜(茄子、西红柿、胡椒、辣椒、土豆等);葫芦科蔬菜(黄瓜、南瓜、西葫芦、西瓜、甜瓜等);十字花科蔬菜(萝卜、芜菁甘蓝、辣根、球茎甘蓝、大白菜、卷心菜、芥菜、西兰花、菜花等);菊科蔬菜(牛蒡、茼蒿、菊芋、生菜等);百合科蔬菜(葱、洋葱、大蒜、芦笋);伞形科蔬菜(胡萝卜、香菜、芹菜、美洲防风等);藜科蔬菜(菠菜、瑞士甜菜等);唇形科蔬菜(紫苏、薄荷、罗勒等);草莓、甘薯、日本薯蓣、芋头等。

[0683] 果树:梨果类(苹果、西洋梨、日本梨、木瓜、榲桲等);核果类(桃子、李子、油桃、梅子、樱桃、杏子、西梅等);柑橘类(温州蜜柑、橙子、柠檬、酸橙、葡萄柚等);坚果类(栗子、胡桃、榛子、杏仁、开心果、腰果、澳洲坚果等);浆果类(蓝莓、蔓越莓、黑莓、覆盆子等);葡萄、柿子、橄榄、枇杷、香蕉、咖啡、海枣、椰树、油棕等。

[0684] 果树以外的树木:茶树、桑树、花木类(皋月杜鹃、山茶、绣球花、茶梅、莽草、樱花、鹅掌楸、紫薇、桂花等);行道树(日本白蜡树、桦树、山茱萸、桉树、银杏、丁香、枫树、橡树、白杨、紫荆、枫香树、梧桐、榉树、日本香柏、枞树、铁杉、杜松、松树、鱼鳞云杉、红豆杉、榆树、七叶树等);珊瑚树、罗汉松、日本柳杉、日本扁柏、巴豆、日本卫矛、光叶石楠等。

[0685] 草坪:结缕草类(结缕草、沟叶结缕草等);百慕大草类(百慕大草等);常绿草类(巨序剪股颖、匍匐剪股颖、细弱剪股颖等);早熟禾类(草地早熟禾、粗茎早熟禾等);羊茅类(苇状羊茅、紫羊茅、高羊茅等);黑麦草类(多花黑麦草、多年生黑麦草等);野茅、梯牧草等。

[0686] 其他:花卉类(蔷薇、康乃馨、菊花、洋桔梗、满天星、非洲菊、金盏花、鼠尾草、矮牵牛、马鞭草、郁金香、紫菀、龙胆、百合、三色堇、仙客来、兰花、铃兰、薰衣草、紫罗兰、羽衣甘蓝、报春花、一品红、唐菖蒲、洋兰、雏菊、兰花、秋海棠等);生物燃料植物(麻风树属、麻风树、红花、亚麻芥类、柳枝稷、芒草、藨草(クサヨシ、Reed canary grass)、芦荻、红麻、木薯、

柳树、藻类等) ;观叶植物等。

[0687] “作物”中也包含基因重组作物。

[0688] 本发明防除剂可以与其他杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀菌剂、植物成长调节剂、除草剂及增效剂混用或并用。该杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀菌剂、除草剂及增效剂的有效成分的例子如下所示。

[0689] 杀虫剂的有效成分

[0690] (1) 有机磷化合物

[0691] 高灭磷(acephate)、磷化铝(Aluminium phosphide)、特噻硫磷(butathiofos)、硫线磷(cadusafos)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、毒虫畏(chlorfenvinphos)、毒死蜱(chlorpyrifos)、甲基毒死蜱(chlorpyrifos-methyl)、杀螟腈(cyanophos:CYAP)、二嗪磷(diazinon)、DCIP(二氯二异丙醚)、除线磷(dichlofenthion:ECP)、敌敌畏(dichlorvos:DDVP)、乐果(dimethoate)、甲基毒虫畏(dimethylvinphos)、乙拌磷(disulfoton)、EPN、乙硫磷(ethion)、灭线磷(ethoprophos)、乙噻硫磷(etrifos)、倍硫磷(fenthion:MPP)、杀螟硫磷(fenitrothion:MEP)、噻唑膦(fosthiazate)、安果(formothion)、磷化氢(Hydrogen phosphide)、异柳磷(isofenphos)、噁唑膦(isoxathion)、马拉硫磷(malathion)、倍硫磷亚砷(mesulfenfos)、杀扑磷(methidathion:DMTP)、久效磷(monocrotophos)、二溴磷(naled:BRP)、异亚砷磷(oxydeprofos:ESP)、对硫磷(parathion)、伏杀磷(phosalone)、亚胺硫磷(phosmet:PMP)、甲基嘧啶磷(pirimiphos-methyl)、啉啉硫磷(pyridafenthion)、喹硫磷(quinalphos)、稻丰散(phenthoate)、丙溴磷(profenofos)、丙虫磷(propaphos)、丙硫磷(prothiofos)、pyraclorfos、蔬果磷(salithion)、硫丙磷(sulprofos)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、双硫磷(temephos)、杀虫畏(tetrachlorvinphos)、特丁磷(terbufos)、甲基乙拌磷(thiometon)、敌百虫(trichlorphon:DEP)、蚜灭多(vamidothion)、甲拌磷(phorate)和硫线磷(cadusafos)。

[0692] (2) 氨基甲酸酯化合物

[0693] 棉铃威(alanycarb)、噁虫威(bendiocarb)、丙硫克百威(benfuracarb)、BPMC、甲萘威(carbaryl)、卡巴呋喃(carbofuran)、丁硫克百威(carbosulfan)、地虫威(cloethocarb)、乙硫苯威(ethiofencarb)、仲丁威(fenobucarb)、苯硫威(fenothiocarb)、苯氧威(fenoxycarb)、呋线威(furathiocarb)、异丙威(isoprocarb:MIPC)、速灭威(metolcarb)、灭多虫(methomyl)、灭虫威(methiocarb)、NAC、草氨酰(oxamyl)、抗蚜威(pirimicarb)、残杀威(propoxur:PHC)、XMC、硫双威(thiodicarb)、灭杀威(xylylcarb)及涕灭威(aldicarb)。

[0694] (3) 拟除虫菊酯化合物

[0695] 氟丙菊酯(acrinathrin)、丙烯菊酯(allethrin)、四氟苯菊酯(benfluthrin)、高效氟氯氰菊酯(beta-cyfluthrin)、联苯菊酯(bifenthrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、氟氯氰菊酯(cyfluthrin)、三氟氯氰菊酯(cyhalothrin)、氯氰菊酯(cypermethrin)、溴氰菊酯(deltamethrin)、高氰戊菊酯(esfenvalerate)、醚菊酯(ethofenprox)、甲氰菊酯(fenpropathrin)、氰戊菊酯(fenvalerate)、氟氰戊菊酯(flucythrinate)、气芬普(flufenprox)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、氟胺氰菊酯(fluvalinate)、苄氟菊酯(halfenprox)、炔咪菊酯(imiprothrin)、苄氯菊酯(permethrin)、炔丙菊酯

(prallethrin)、炔丙菊酯(pyrethrins)、苜呋菊脂(resmethrin)、sigma-氯氰菊酯(sigma-cypermethrin)、氟硅菊酯(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin)、四溴菊酯(tralomethrin)、四氟苯菊酯(transfluthrin)、胺菊酯(tetramethrin)、苯醚菊酯(phenothrin)、苯氰菊酯(cyphenothrin)、alpha-氯氰菊酯(alpha-cypermethrin)、zeta-氯氰菊酯(zeta-cypermethrin)、高效氯氟氰菊酯(lambda-cyhalothrin)、氯氟氰菊酯(gamma-cyhalothrin)、炔呋菊酯(furamethrin)、氟胺氰菊酯(tau-fluvalinate)、甲氧苄氟菊酯(metofluthrin)、pofluthrin、四氟甲醚菊酯(dimefluthrin)、2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苄基(EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-二甲基-3-丙烯-1-基环丙烷羧酸酯、2,3,5,6-四氟-4-甲基苄基(EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-二甲基-3-丙烯-1-基环丙烷羧酸酯、2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苄基(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-二甲基-3-(2-甲基-1-丙烯基)环丙烷羧酸酯和2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苄基(EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-二甲基-3-(2-氰基-1-丙烯基)环丙烷羧酸酯。

[0696] (4) 沙蚕毒素化合物

[0697] 杀螟丹(cartap)、杀虫磺(bensultap)、杀虫环(thiocyclam)、杀虫单(monosultap)、和杀虫双(bisultap)。

[0698] (5) 新烟碱化合物

[0699] 吡虫啉(imidacloprid)、烯啶虫胺(nitenpyram)、啉虫脒(acetamiprid)、噻虫嗪(thiamethoxam)、噻虫啉(thiacloprid)、呋虫胺(dinotefuran)、和噻虫胺(clothianidin)。

[0700] (6) 苯甲酰脲化合物

[0701] 定虫隆(chlorfluazuron)、双三氟虫脲(bistrifluron)、丁醚脲(diafenthiuron)、二氟脲(diflubenzuron)、啉蝼脲(fluzuron)、氟螞脲(flucycloxuron)、氟虫脲(flufenoxuron)、氟铃脲(hexaflumuron)、氯芬奴隆(lufenuron)、双苯氟脲(novaluron)、多氟脲(noviflumuron)、氟苯脲(teflubenzuron)、杀铃脲(triflumuron)及敌百虫(triazuron)。

[0702] (7) 苯基吡唑化合物

[0703] 乙酰虫脞(acetoprole)、乙虫脞(ethiprole)、氟虫脞(fipronil)、vaniliprole、pyriprole、和匹弗普罗(pyrafluprole)。

[0704] (8) Bt杀虫剂

[0705] 来源于苏云金杆菌的生芽胞和产生的晶体毒素、以及它们的混合物。

[0706] (9) 胍化合物

[0707] 环虫酰胍(chromafenozide)、氯虫酰胍(halofenozide)、甲氧虫酰胍(methoxyfenozide)、和虫酰胍(tebufenozide)。

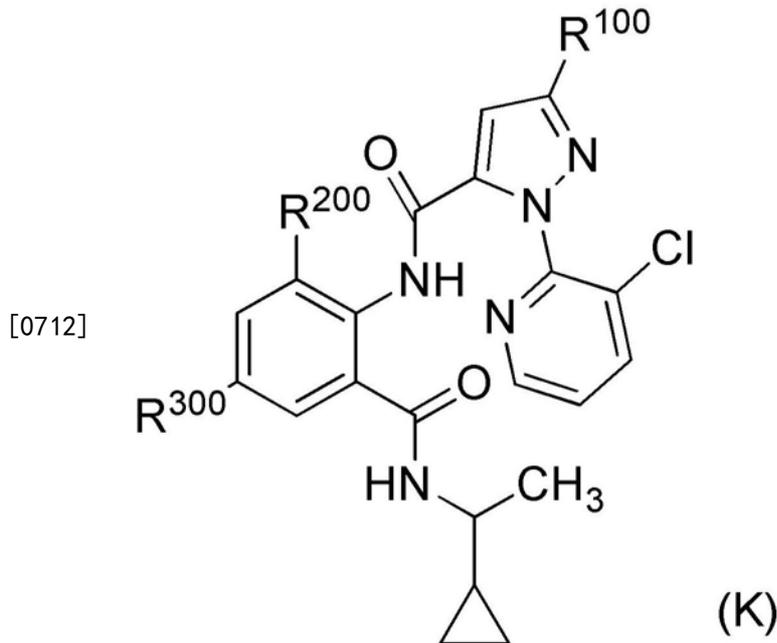
[0708] (10) 有机氯化物

[0709] 艾氏剂(aldrin)、狄氏剂(dieldrin)、除螨灵(dienochlor)、硫丹(endosulfan)、甲氧滴滴涕(methoxychlor)。

[0710] (11) 其他杀虫剂有效成分

[0711] 机油(machine oil)、硫酸尼古丁(nicotine-sulfate);阿维菌素-B(ivermectin-B)、溴代丙烯酸酯(bromopropylate)、噻嗪酮(buprofezin)、溴虫清(chlorphenapyr)、氰虫

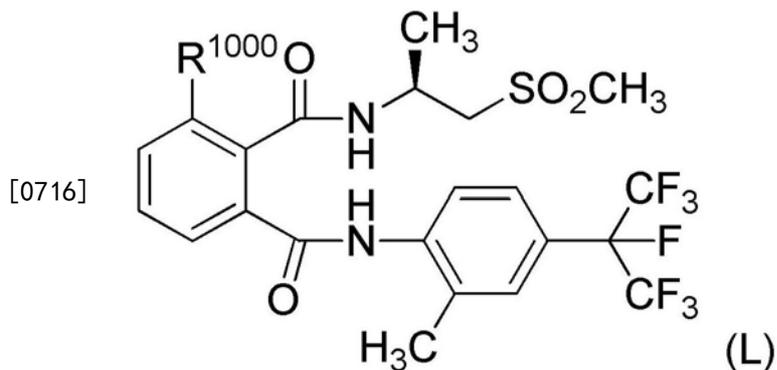
酰胺(cyantraniliprole)、灭蝇胺(cyromazine)、D-D(1,3-Dichloropropene)、埃玛菌素苯甲酸盐(emamectin-benzoate)、啉啉醚(fenazaquin)、吡氟硫磷(flupyrzofos)、烯虫乙酯(hydroprene)、甲氧普林(methoprene)、茚虫威(indoxacarb)、噁虫酮(metoxadiazone)、倍脉心A(milbemycin-A)、吡蚜酮(pymetrozine)、啉虫丙醚(pyridalyl)、吡丙醚(pyriproxyfen)、多杀菌素(spinosad)、氟虫胺(sulfluramid)、啉虫酰胺(tolfenpyrad)、啉蚜威(triazamate)、氟虫酰胺(flubendiamide)、雷皮菌素(lepimectin)、砷酸(Arsenic acid)、benclothiaz、石灰氮(Calcium cyanamide)、石灰硫磺合剂(Calcium polysulfide)、氯丹(chlordane)、DDT、DSP、啉虫胺(flufenerim)、氟啉虫酰胺(flonicamid)、flurimfen、伐虫脒(formetanate)、安百亩(metam-ammonium)、威百亩(metam-sodium)、溴甲烷(Methylbromide)、油酸钾(Potassium oleate)、protrifenbute、螺甲啉酯(spiromesifen)、砒虫啉(sulfoxaflor)、硫磺(Sulfur)、氰氟虫腙(metaflumizone)、螺虫乙酯(spirotetramat)、氟虫吡啶(pyrifluquinazone)、乙基多杀菌素(spinetoram)、氯虫苯甲酰胺(chlorantraniliprole)、溴代吡咯啉(tralopyril)、氰虫酰胺(cyantraniliprole)、下式(K)所示的化合物



[0713] (式中, R^{100} 表示氯、溴或三氟甲基,

[0714] R^{200} 表示氯、溴或甲基,

[0715] R^{300} 表示氯、溴或氰基。)、及下式(L)所示的化合物



[0717] (式中,R¹⁰⁰⁰表示氯、溴或碘。)

[0718] 杀螨剂的有效成分

[0719] 灭螨醌(acequinocyl)、双甲脒(amitraz)、苯螨特(benzoximate)、联苯腈酯(bifenaate)、溴螨酯(bromopropylate)、灭螨猛(chinomethionat)、克氯苯(chlorobenzilate)、CPCBS(chlorfenson,杀螨酯)、四螨嗪(clofentezine)、丁氟螨酯(cyflumetofen)、三氯杀螨醇(dicofol)、乙螨唑(etoxazole)、苯丁锡(fenbutatin oxide)、苯硫威(fenothiocarb)、唑螨酯(fenpyroximate)、噁螨酯(flucrypyrim)、苜螨醚(fluproxyfen)、噻螨酮(hexythiazox)、克螨特(propargite:BPPS)、浏阳霉素(polynactins)、吡螨灵(pyridaben)、噁螨醚(Pyrimidifen)、吡螨胺(tebufenpyrad)、四氯杀螨砜(tetradifon)、螺螨酯(spirodiclofen)、螺甲螨酯(spiromesifen)、螺虫乙酯(spirotetramat)、磺胺螨酯(amidoflumet)及腈吡螨酯(cyenopyrafen)。

[0720] 杀线虫剂的有效成分

[0721] DCIP、噻唑膦(fosthiazate)、盐酸左旋咪唑(levamisol)、异硫氰酸甲酯(methyisothiocyanate)、酒石酸甲噻嘧啶(morantel tartarate)及imicyafos。

[0722] 杀菌剂的有效成分

[0723] 丙环唑(propiconazole)、丙硫菌唑(prothioconazole)、三唑醇(triadimenol)、唑菌醇(prochloraz)、戊菌唑(penconazole)、戊唑醇(tebuconazole)、氟硅唑(flusilazole)、烯唑醇(diniconazole)、糠菌唑(bromuconazole)、氟环唑(epoxiconazole)、苯醚甲环唑(difenoconazole)、环唑醇(cyproconazole)、叶菌唑(metconazole)、氟菌唑(triflumizole)、氟醚唑(tetraconazole)、腈菌唑(myclobutanil)、腈苯唑(fenbuconazole)、己唑醇(hexaconazole)、氟喹唑(flquinconazole)、灭菌唑(triticonazole)、联苯三唑醇(bitertanol)、伊米萨利(imazalil)、粉唑醇(flutriafol)等唑类杀菌化合物;

[0724] 丁苯吗啉(fenpropimorph)、克啉菌(tridemorph)、苯锈啉(fenpropidin)等环状胺杀菌化合物;

[0725] 多菌灵(carbendezim)、苯来特(benomyl)、噻苯咪唑(thiabendazole)、甲基托布津(thiophanate-methyl)等苯并咪唑杀菌化合物;

[0726] 腐霉利(procymidone);噁菌环胺(cyprodinil);噁霉胺(pyrimethanil);乙霉威(diethofencarb);秋兰姆(thiuram);氟啉胺(fluzinam);代森锰锌(mancozeb);异菌脲(iprodione);农利灵(vinclozolin);百菌清(chlorothalonil);克菌丹(captan);噁菌胺(mepanipyrim);拌种咯(fenpiclonil);咯菌腈(fludioxonil);抑菌灵(dichlofluanid);灭菌丹(folpet);醚菌酯(kresoxim-methyl);噁菌酯(azoxystrobin);肟菌酯(trifloxystrobin);氟噁菌酯(fluxastrobin);啉氧菌酯(picoxystrobin);唑菌胺酯(pyraclostrobin);醚菌胺(dimoxystrobin);吡菌苯威(pyribencarb);螺环菌胺(spiroxamine);喹氧灵(quinoxyfen);fenhexamid;噁唑菌酮(famoxadone);咪唑菌酮(fenamidone);苯酰菌胺(zoxamide);噻唑菌胺(ethaboxam);安美速(amisulbrom);丙森锌(iprovalicarb);苯噻菌胺(benthiavalicarb);氰霜唑(cyazofamid);双炔酰菌胺(mandipropamid);啉酰菌胺(boscalid);吡噻菌胺(penthiopyrad);苯菌酮(metrafenone);fluopiran;联苯吡菌胺(bixafen);环氟菌胺(cyflufenamid);丙氧喹啉

(proquinazid); 异噻菌胺 (isotianil) 和噻酰菌胺 (tiadinil)。

[0727] 除草剂的有效成分

[0728] (1) 苯氧基脂肪酸除草性化合物

[0729] 2,4-PA、MCP、MCPB、酚硫杀 (phenothiol)、氯苯氧丙酸 (mecoprop)、使它隆 (fluroxypyr)、绿草定 (triclopyr)、氯甲酰草胺 (clomeprop) 及萘丙胺 (naproanilide)。

[0730] (2) 苯甲酸除草性化合物

[0731] 2,3,6-TBA、麦草畏 (dicamba)、二氯吡啶酸 (clopyralid)、毒莠定 (picloram)、氯氨基吡啶酸 (aminopyralid)、快杀稗 (quinclorac) 及氯甲喹啉酸 (quinmerac)。

[0732] (3) 脲除草性化合物

[0733] 敌草隆 (diuron)、利谷隆 (linuron)、绿麦隆 (chlortoluron)、异丙隆 (isoproturon)、伏草隆 (fluometuron)、异噁隆 (isouron)、丁噁隆 (tebuthiuron)、噻唑隆 (methabenzthiazuron)、苜草隆 (cumyluron)、杀草隆 (daimuron) 及甲基杀草隆 (methyl-daimuron)。

[0734] (4) 三嗪除草性化合物

[0735] 草脱净 (atrazine)、莠灭净 (ametoryn)、草净津 (cyanazine)、西玛津 (simazine)、扑灭津 (propazine)、西草净 (simetryn)、异戊乙净 (dimethametryn)、扑草净 (prometryn)、赛克津 (metribuzin)、三嗪氟草胺 (triaziflam) 及三嗪茛草胺 (indaziflam)。

[0736] (5) 双吡啶鎏除草性化合物

[0737] 百草枯 (paraquat) 及敌草快 (diquat)。

[0738] (6) 羟基苄腈除草性化合物

[0739] 溴草腈 (bromoxynil) 及碘草腈 (ioxynil)。

[0740] (7) 二硝基苯胺除草性化合物

[0741] 二甲戊乐灵 (pendimethalin)、氨基乐灵 (prodiamine) 及氟乐灵 (trifluralin)。

[0742] (8) 有机磷除草性化合物

[0743] 甲胺草磷 (amiprofos-methyl)、抑草磷 (butamifos)、地散磷 (bensulide)、哌草磷 (piperophos)、莎稗磷 (anilofos)、草甘膦 (glyphosate)、草铵膦 (glufosinate)、草铵膦-P (glufosinate-P) 及双丙氨膦 (bialaphos)。

[0744] (9) 氨基甲酸酯除草性化合物

[0745] 燕麦敌 (di-allate)、野麦畏 (tri-allate)、EPTC、丁草敌 (butylate)、杀草丹 (benthiocarb)、戊草丹 (esprocarb)、草达灭 (molinate)、哌草丹 (dimepiperate)、灭草灵 (swep)、氯普芬 (chlorpropham)、甜菜宁 (phenmedipham)、棉胺宁 (phenisopham)、稗草畏 (pyributicarb) 及黄草灵 (asulam)。

[0746] (10) 酰胺除草性化合物

[0747] 敌稗 (propanil)、拿草特 (propyzamide)、溴丁酰草胺 (bromobutide) 及乙氧苯草胺 (etobenzanid)。

[0748] (11) 氯乙酰苯胺除草性化合物

[0749] 乙草胺 (acetochlor)、甲草胺 (alachlor)、丁草胺 (butachlor)、二甲酚草胺 (dimethenamid)、扑草胺 (propachlor)、吡草胺 (metazachlor)、异丙甲草胺 (metolachlor)、丙草胺 (pretilachlor)、甲氧噻草胺 (thenylchlor)、及烯草胺

(pethoxamid)。

[0750] (12) 二苯醚除草性化合物

[0751] 三氟羧草醚(acifluorfen-sodium)、治草醚(bifenox)、乙氧氟草醚(oxyfluorfen)、乳氟禾草灵(lactofen)、氟磺胺草醚(fomesafen)、氯硝醚(chlomethoxynil)及苯草醚(aclonifen)。

[0752] (13) 环状酰亚胺除草性化合物

[0753] 噁草灵(oxadiazon)、吡啶酮草酯(cinidon-ethyl)、唑草酮(carfentrazone-ethyl)、surfentrazone、氟烯草酸(flumiclorac-pentyl)、丙炔氟草胺(flumioxazin)、吡草醚(pyraflufen-ethyl)、丙炔噁草酮(oxadiargyl)、环戊噁草酮(pentoxazone)、氟噻甲草酯(fluthiacet-methyl)、氟丙嘧草酯(butafenacil)、双苯嘧草酮(benzfendizone)、bencarbazone及苯嘧磺草胺(saflufenacil)。

[0754] (14) 吡唑除草性化合物

[0755] 吡草酮(benzofenap)、吡唑特(pyrazolate)、苜草唑(pyrazoxyfen)、苯吡唑草酮(topramezone)及磺酰草吡唑(pyrasulfotole)。

[0756] (15) 三酮除草性化合物

[0757] 异噁唑草酮(isoxaflutole)、双环磺草酮(benzobicyclon)、磺草酮(sulcotrione)、硝磺草酮(mesotrione)、环磺酮(tembotrione)及特呋三酮(tefuryltrione)。

[0758] (16) 芳氧基苯氧基丙酸除草性化合物

[0759] 炔草酯(clodinafop-propargyl)、氰氟草酯(cyhalofop-butyl)、禾草灵(diclofop-methyl)、噁唑禾草灵(fenoxaprop-ethyl)、吡氟禾草灵(fluzafop-butyl)、氟吡甲禾灵(haloxfop-methyl)及喹禾灵(quizalofop-ethyl)、噁唑酰草胺(metamifop)。

[0760] (17) 三酮肟除草性化合物

[0761] 禾草灭(alloxydim-sodium)、稀禾定(sethoxydim)、丁氧环酮(butroxydim)、烯草酮(clethodim)、cloproxydim、噁草酮(cycloxydim)、吡喃草酮(tepraloxym)、肟草酮(tralkoxydim)及氯苯噁草酮(profoxydim)。

[0762] (18) 磺酰脲除草性化合物

[0763] 氯磺隆(chlorsulfuron)、甲嘧黄隆(sulfometuron-methyl)、甲磺隆(metsulfuron-methyl)、氯嘧磺隆(chlorimuron-ethyl)、苯磺隆(tribenuron-methyl)、醚苯磺隆(triasulfuron)、苄嘧磺隆(bensulfuron-methyl)、噻磺隆(thifensulfuron-methyl)、吡嘧磺隆(pyrazosulfuron-ethyl)、氟嘧磺隆(primisulfuron-methyl)、烟嘧磺隆(nicosulfuron)、酰胺磺隆(amidosulfuron)、醚磺隆(cinosulfuron)、唑吡嘧磺隆(imazosulfuron)、玉嘧磺隆(rimsulfuron)、氯吡嘧磺隆(halosulfuron-methyl)、氟磺隆(prosulfuron)、胺苯磺隆(ethametsulfuron-methyl)、氟胺磺隆(triflusulfuron-methyl)、啶嘧磺隆(flazasulfuron)、环胺磺隆(cyclosulfamuron)、磺隆(flupyr-sulfuron)、磺酰磺隆(sulfosulfuron)、四唑嘧磺隆(azimsulfuron)、乙氧嘧磺隆(ethoxysulfuron)、环氧嘧磺隆(oxasulfuron)、碘甲磺隆钠(iodosulfuron-methyl-sodium)、甲酰胺磺隆(foramsulfuron)、甲磺胺磺隆(mesosulfuron-methyl)、三氟啶磺隆(trifloxysulfuron)、三氟甲磺隆(tritosulfuron)、嘧苯胺磺隆(orthosulfamuron)、氟吡

磺隆(flucetosulfuron)及propyrisulfuron。

[0764] (19)咪唑啉酮除草性化合物

[0765] 咪草酸(imazamethabenz-methyl)、imazamethapyr、甲氧咪草烟(imazamox)、灭草烟(imazapyr)、咪唑喹啉酸(imazaquin)及咪唑乙烟酸(imazethapyr)等。

[0766] (20)磺酰胺除草性化合物

[0767] 唑嘧磺草胺(flumetsulam)、磺草唑胺(metosulam)、双氯磺草胺(diclosulam)、双氟磺草胺(florasulam)、氯酯磺草胺(cloransulam-methyl)、五氟磺草胺(penoxsulam)及啶磺草胺(pyroxulam)。

[0768] (21)羟基嘧啶苯甲酸除草性化合物

[0769] 嘧草硫醚(pyriithiobac-sodium)、双草醚(bispyribac-sodium)、嘧草醚(pyriminobac-methyl)、嘧啶肟草醚(pyribenzoxim)、环酯草醚(pyriftalid)及吡丙醚(pyrimisulfan)。

[0770] (22)其他除草性化合物

[0771] 噻草平(bentazon)、除草定(bromacil)、特草定(terbacil)、草克乐(chlorthiamid)、异噁草胺(isoxaben)、地乐酚(dinoseb)、杀草强(amitrole)、环庚草醚(cinmethylin)、灭草环(tridiphane)、茅草枯(dalapon)、隆钠(diflufenzopyr-sodium)、氟硫草定(dithiopyr)、噻唑烟酸(thiazopyr)、氟酮磺隆(flucarbazone-sodium)、丙苯磺隆(propoxycarbazone-sodium)、苯噻酰草胺(mefenacet)、氟噻草胺(flufenacet)、四唑酰草胺(fentrazamide)、唑草胺(cafenstrole)、茚草酮(indanofan)、噁嗪草酮(oxaziclomefone)、呋草黄(benfuresate)、ACN、吡草特(pyridate)、杀草敏(chloridazon)、达草灭(norfiurazon)、呋草酮(flurtamone)、吡氟酰草胺(diflufenican)、氟吡酰草胺(picolinafen)、氟丁酰草胺(beflubutamid)、广灭灵(clomazone)、氨基草酮(amicarbazone)、唑啉草酯(pinoxaden)、双唑草腈(pyraclonil)、罗克杀草砜(pyroxasulfone)、噻酮磺隆(thiencarbazone-methyl)、环丙嘧啶酸(aminocyclopyrachlor)、ipfencarbazone及methiozolin。

[0772] 增效剂的有效成分

[0773] 增效醚(piperonyl butoxide)、增效菊(sesamex)、亚砷(sulfoxide)、N-(2-乙基己基)-8,9,10-三降冰片-5-烯-2,3-二甲酰亚胺(MGK 264)、N-癸基咪唑(N-declyimidazole)、WARF-antiresistant、脱叶磷(TBPT)、亚磷酸三苯酯(TPP)、异稻瘟净(IBP)、碘代甲烷(CH₃I)、对苯基丁酮(t-phenylbutenone)、马来酸二乙酯(diethylmaleate)、双(对氯苯基)甲基甲醇(DMC)和双(对氯苯基)三氟甲基甲醇(FDMC)。

[0774] [实施例]

[0775] 以下,通过制造例、制剂例和试验例等进一步详细说明本发明防除剂的化合物,但本发明并不限于这些例子。

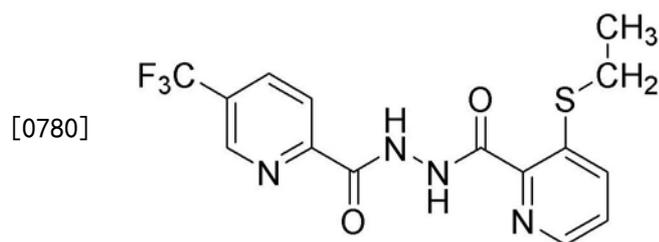
[0776] 首先对本化合物的制造示出制造例。

[0777] 制造例1(1)

[0778] 在5-(三氟甲基)吡啶-2-羧酰肼0.37g和THF 20mL的混合物中在冰冷条件下加入3-(乙基硫基)吡啶-2-羧基氯化物0.40g和THF 5mL的混合物,接着在冰冷条件下加入吡啶0.27g,在室温搅拌2小时。在反应混合物中加入饱和碳酸氢钠水溶液,用乙酸乙酯萃取。将

有机层用无水硫酸钠干燥,在减压条件下浓缩,由此得到下述所示的中间体(1) 0.55g。

[0779] 中间体(1)

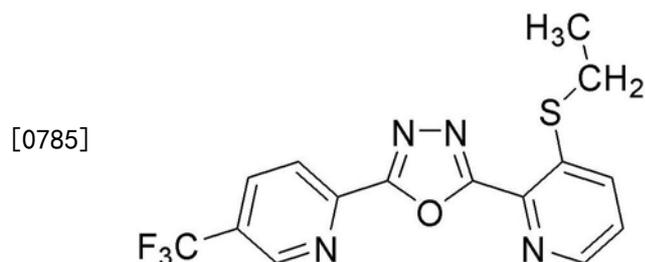


[0781] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 10.46 (2H, brs), 8.88 (1H, s), 8.36-8.31 (2H, m), 8.14 (1H, d), 7.70 (1H, d), 7.41 (1H, dd), 2.95 (2H, q), 1.42 (3H, t)

[0782] 制造例1 (2)

[0783] 在氧氯化磷10g中在室温加入中间体(1) 0.41g,加热回流条件下搅拌1小时。将放冷至室温的反应混合物在减压条件下浓缩,在得到的残渣中加入饱和碳酸氢钠水溶液,用乙酸乙酯萃取。将有机层用无水硫酸钠干燥,在减压条件下浓缩。将得到的残渣供于硅胶柱色谱,得到下述所示的化合物(以下,记作本化合物1-1) 0.12g。

[0784] 本化合物1-1

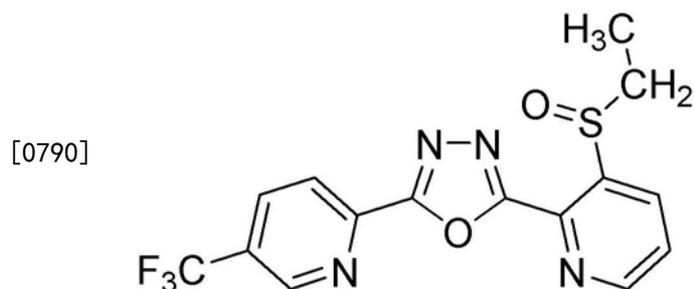


[0786] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.08 (1H, s), 8.59 (1H, d), 8.49 (1H, d), 8.16 (1H, d), 7.80 (1H, d), 7.42 (1H, dd), 3.07 (2H, q), 1.45 (3H, t)

[0787] 制造例2

[0788] 在本化合物1-1 (0.10g) 和氯仿10mL的混合物中在冰冷条件下加入间氯过苯甲酸(纯度65%以上) 0.23g,在室温搅拌2小时。在反应混合物中加入10% 硫代硫酸钠水溶液,在室温搅拌10分钟。将有机层用饱和碳酸氢钠水溶液、水、饱和氯化钠水溶液依次洗涤,用无水硫酸钠干燥后,在减压条件下浓缩。将得到的残渣供于硅胶柱色谱,得到下述所示的本化合物1-2 0.02g和本化合物1-3 0.06g。

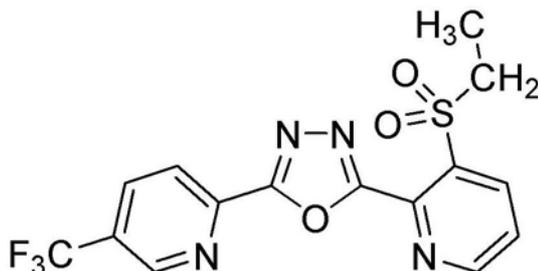
[0789] 本化合物1-2



[0791] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.10 (1H, s), 8.94 (1H, dd), 8.65 (1H, dd), 8.48 (1H, d), 8.19 (1H, dd), 7.77 (1H, dd), 3.53-3.42 (1H, m), 3.09-2.98 (1H, m), 1.40 (3H, t)

[0792] 本化合物1-3

[0793]



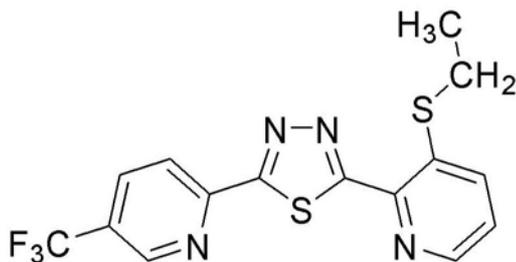
[0794] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.07 (1H, s), 9.05 (1H, dd), 8.58 (1H, dd), 8.47 (1H, d), 8.18 (1H, dd), 7.77 (1H, dd), 3.90 (2H, q), 1.42 (3H, t)

[0795] 制造例3

[0796] 在中间体 (1) 0.14g 和 1,4-二噁烷 5mL 的混合物中在室温加入劳森试剂 0.32g, 在 100°C 搅拌 1 小时。将反应混合物放冷到室温, 加入水和饱和碳酸氢钠水溶液, 用乙酸乙酯萃取。将有机层用无水硫酸钠干燥, 在减压条件下浓缩, 由此得到下述所示的化合物 (以下, 记作本化合物 1-40) 0.14g。

[0797] 本化合物 1-40

[0798]



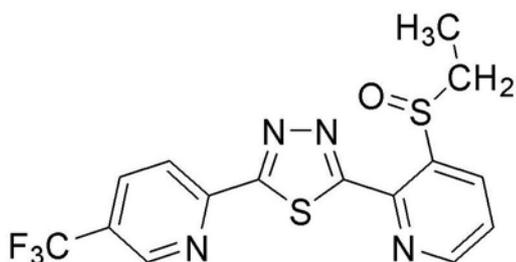
[0799] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.94 (1H, s), 8.56 (1H, d), 8.46 (1H, d), 8.11 (1H, d), 7.76 (1H, d), 7.34 (1H, dd), 3.05 (2H, q), 1.46 (3H, t)

[0800] 制造例 4

[0801] 在本化合物 1-40 (0.14g) 和氯仿 10mL 的混合物中在冰冷条件下加入间氯过苯甲酸 (纯度 65% 以上) 0.27g, 升温至室温, 在室温搅拌 2 小时。在反应混合物中加入 10% 硫代硫酸钠水溶液, 在室温搅拌 10 分钟。将有机层用饱和碳酸氢钠水溶液、水、饱和氯化钠水溶液依次洗涤, 用无水硫酸钠干燥后, 在减压条件下浓缩。将得到的残渣供于硅胶柱色谱, 得到下述所示的化合物 (以下, 记作本化合物 1-4) 0.17g。

[0802] 本化合物 1-4

[0803]

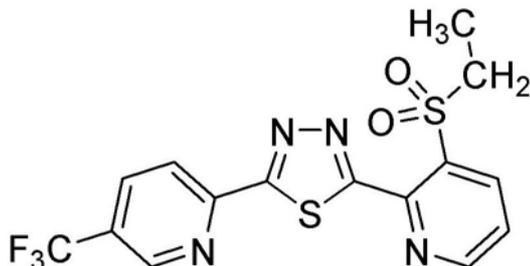


[0804] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.97 (1H, s), 8.79 (1H, dd), 8.64 (1H, dd), 8.54 (1H, d), 8.15 (1H, dd), 7.68 (1H, dd), 3.54-3.43 (1H, m), 3.10-2.99 (1H, m), 1.39 (3H, t)

[0805] 制造例 5

[0806] 在本化合物1-4 (0.15g) 和氯仿10mL的混合物中在冰冷条件下加入间氯过苯甲酸 (纯度65%以上) 0.23g, 在室温搅拌1天。在反应混合物中加入10% 硫代硫酸钠水溶液, 在室温搅拌10分钟。将有机层用饱和碳酸氢钠水溶液、水、饱和氯化钠水溶液依次洗涤, 用无水硫酸钠干燥后, 在减压条件下浓缩。将得到的残渣供于硅胶柱色谱, 得到下述所示的化合物 (以下, 记作本化合物1-5) 0.13g。

[0807]



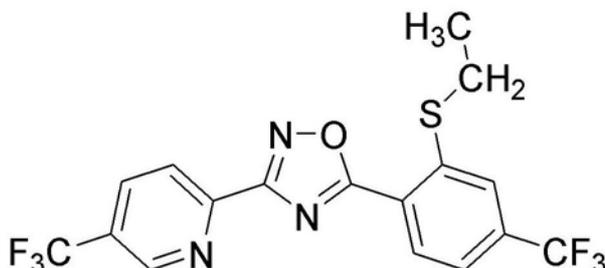
[0808] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.95 (1H, s), 8.93 (1H, dd), 8.62 (1H, dd), 8.54 (1H, d), 8.15 (1H, dd), 7.67 (1H, dd), 4.08 (2H, q), 1.43 (3H, t)

[0809] 制造例6

[0810] 在N'-羟基-5-(三氟甲基)吡啶-2-甲脒 (carboximidamide) 0.41g和DMF 5mL的混合物中在室温加入2-(乙基硫基)-4-(三氟甲基)苯甲酰基氯化物0.50g和DMF 5mL的混合物, 接着加入三乙胺0.30g, 加热回流条件下搅拌2小时。将反应混合物放冷到室温, 加入饱和碳酸氢钠水溶液, 用乙酸乙酯萃取。将有机层用无水硫酸钠干燥, 在减压条件下浓缩。将得到的残渣供于硅胶柱色谱, 得到下述所示的化合物 (以下, 记作本化合物1-6) 0.21g。

[0811] 本化合物1-6

[0812]



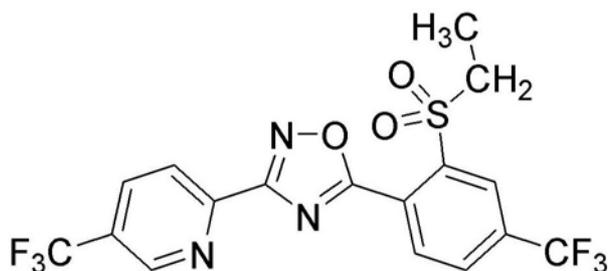
[0813] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.10 (1H, s), 8.40 (1H, d), 8.32 (1H, d), 8.16 (1H, d), 7.66 (1H, s), 7.54 (1H, d), 3.12 (2H, q), 1.46 (3H, t).

[0814] 制造例7

[0815] 在本化合物1-6 (0.10g) 和氯仿10mL的混合物中在冰冷条件下加入间氯过苯甲酸 (纯度65%以上) 0.14g, 在室温搅拌2小时。在反应混合物中加入10% 硫代硫酸钠水溶液, 在室温搅拌10分钟。将有机层用饱和碳酸氢钠水溶液、水、饱和氯化钠水溶液依次洗涤, 用无水硫酸钠干燥后, 在减压条件下浓缩。将得到的残渣供于硅胶柱色谱, 得到下述所示的化合物 (以下, 记作本化合物1-7) 0.10g。

[0816] 本化合物1-7

[0817]



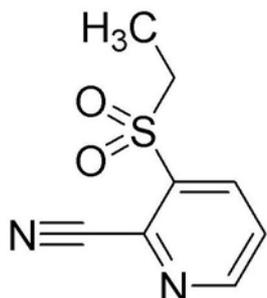
[0818] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.09 (1H, s), 8.51 (1H, s), 8.33 (1H, d), 8.19–8.10 (3H, m), 3.73 (2H, q), 1.44 (3H, t).

[0819] 制造例8 (1)

[0820] 在2-氰基-3-(乙基硫基)吡啶2.31g和氯仿20mL的混合物中在冰冷条件下加入间氯过苯甲酸(纯度65%以上)5.29g,在室温搅拌2小时。在反应混合物中加入10%硫代硫酸钠水溶液,在室温搅拌10分钟。将有机层用饱和碳酸氢钠水溶液、水、饱和氯化钠水溶液依次洗涤,用无水硫酸钠干燥后,在减压条件下浓缩。将得到的残渣供于硅胶柱色谱,得到下述所示的中间体(2)1.49g。

[0821] 中间体(2)

[0822]

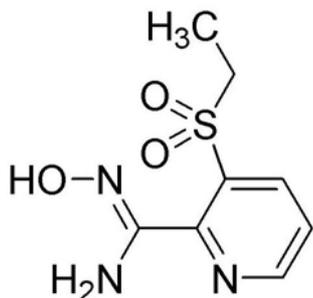


[0823] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.97 (1H, dd), 8.47 (1H, dd), 7.77 (1H, dd), 3.48 (2H, q), 1.38 (3H, t).

[0824] 制造例8 (2)

[0825] 在羟基胺盐酸盐1.61g和乙醇15mL的混合物中加入碳酸氢钠1.93g,在加热回流条件下搅拌45分钟。放冷至室温后,将反应混合物冰冷,加入中间体(2)2.15g,在室温搅拌2小时。在反应混合物中加入水和饱和氯化铵水溶液,用乙酸乙酯萃取。将有机层用无水硫酸钠干燥,在减压条件下浓缩,由此得到下述所示的中间体(3)2.02g。

[0826]



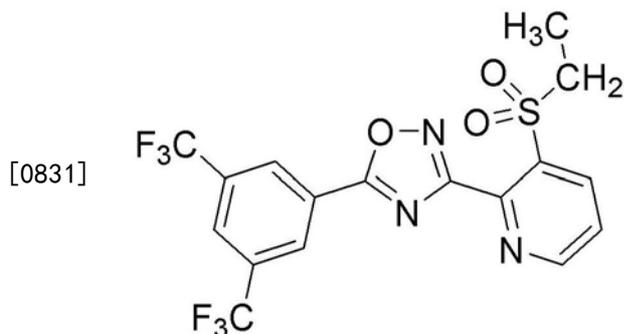
[0827] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.83 (1H, d), 8.47 (1H, d), 7.56 (1H, dd), 6.70 (1H, brs), 5.27 (2H, brs), 3.75 (2H, q), 1.29 (3H, t).

[0828] 制造例8 (3)

[0829] 在中间体(3)0.23g和DMF 2mL的混合物中在室温加入3,5-双(三氟甲基)苯甲酰基

氯化物0.26g和DMF 1mL的混合物,接着加入三乙基胺0.15g,在80℃搅拌2小时、并在加热回流条件下搅拌2小时。在放冷至室温的在反应混合物中加入加入饱和碳酸氢钠水溶液,用乙酸乙酯萃取。将有机层用无水硫酸钠干燥,在减压条件下浓缩。将得到的残渣供于硅胶柱色谱,得到下述所示的化合物(以下,记作本化合物1-15)0.21g。

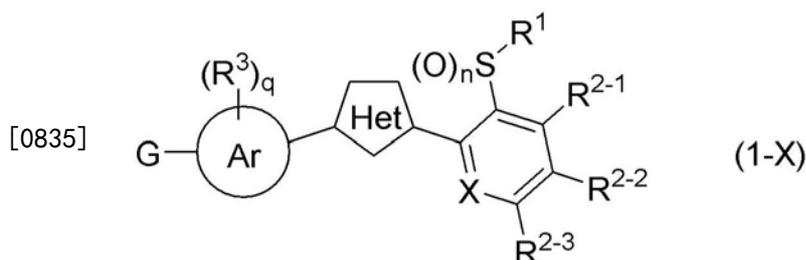
[0830] 本化合物1-15



[0832] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.07 (1H, dd), 8.70 (2H, s), 8.55 (1H, dd), 8.14 (1H, s), 7.76 (1H, dd), 3.73 (2H, q), 1.42 (3H, t).

[0833] 将按照上述制造例中记载的方法制造的化合物示出在(表1)~(表2)中。

[0834] 式(1-X)所示的化合物



[0836] [式中, R^{2-1} 、 R^{2-2} 和 R^{2-3} 各自独立地表示与 R^2 相同的含义,其他记号表示与式(1)相同的含义]。

[0837] 式中, R^1 、 n 、 R^{2-1} 、 R^{2-2} 、 R^{2-3} 、 X 、 Het 、 $(\text{R}^3)_q\text{GAR}$ -表示下述(表1)~(表2)中记载的组合。

[0838] 【表1】

[0839]

本化合物	R^1	n	R^{2-1}	R^{2-2}	R^{2-3}	X	Het	$(\text{R}^3)_q\text{GAR}$ -
1-1	CH_2CH_3	0	H	H	H	N	H2-0	5-(三氟甲基)吡啶-2-基
1-2	CH_2CH_3	1	H	H	H	N	H2-0	5-(三氟甲基)吡啶-2-基
1-3	CH_2CH_3	2	H	H	H	N	H2-0	5-(三氟甲基)吡啶-2-基
1-4	CH_2CH_3	1	H	H	H	N	H2-S	5-(三氟甲基)吡啶-2-基
1-5	CH_2CH_3	2	H	H	H	N	H2-S	5-(三氟甲基)吡啶-2-基
1-6	CH_2CH_3	0	H	CF_3	H	CH	H3-0	5-(三氟甲基)吡啶-2-基
1-7	CH_2CH_3	2	H	CF_3	H	CH	H3-0	5-(三氟甲基)吡啶-2-基
1-8	CH_2CH_3	2	H	H	H	N	H3-0	5-(三氟甲基)吡啶-2-基
1-9	CH_2CH_3	1	H	CF_3	H	CH	H2-S	5-(三氟甲基)吡啶-2-基
1-10	CH_2CH_3	0	H	CF_3	H	CH	H2-S	5-(三氟甲基)吡啶-2-基
1-11	CH_2CH_3	2	H	H	H	N	H1-0	5-(三氟甲基)吡啶-2-基

1-12	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	4-(三氟甲基)苯基
1-13	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	3-(三氟甲基)苯基
1-14	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	2-(三氟甲基)苯基
1-15	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	3,5-双(三氟甲基)苯基
1-16	CH ₂ CH ₃	2	H	CF ₃	H	CH	H1-0	3,5-双(三氟甲基)苯基
1-17	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	4-(三氟甲基硫基)苯基
1-18	CH ₂ CH ₃	2	H	CF ₃	H	CH	H1-0	4-(三氟甲基硫基)苯基
1-19	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H3-0	3,5-双(三氟甲基)苯基
1-20	CH ₂ CH ₃	2	H	CF ₃	H	CH	H3-0	3,5-双(三氟甲基)苯基
1-21	CH ₂ CH ₃	2	H	CF ₃	H	N	H1-0	3,5-双(三氟甲基)苯基
1-22	CH ₂ CH ₃	2	H	CF ₃	H	N	H3-0	3,5-双(三氟甲基)苯基
1-23	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	CH	H3-0	3,5-双(三氟甲基)苯基
1-24	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	CH	H1-0	3,5-双(三氟甲基)苯基
1-25	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H2-0	3,5-双(三氟甲基)苯基

[0840] 【表2】

[0841]

本化合物	R ¹	n	R ²⁻¹	R ²⁻²	R ²⁻³	X	Het	(R ³) _q GA _r -
1-26	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	3-氟-5-(三氟甲基)苯基
1-27	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	3-溴-5-(三氟甲基)苯基
1-28	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	4-氟-3-(三氟甲基)苯基
1-29	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	4-(三氟甲基)吡啶-2-基
1-30	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	5-(三氟甲基)吡啶-3-基
1-31	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	2-(三氟甲基)吡啶-4-基
1-32	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	3-(三氟甲基硫基)苯基
1-33	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	6-(三氟甲基)吡啶-2-基
1-34	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	3,5-二溴苯基
1-35	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	3,5-二氟苯基
1-36	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基
1-37	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	5-(三氟甲基)噻吩-2-基
1-38	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	3,5-二氯苯基
1-39	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H2-S	3,5-双(三氟甲基)苯基
1-40	CH ₂ CH ₃	0	H	H	H	N	H2-S	5-(三氟甲基)吡啶-2-基
1-41	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	4-氯-1,3-苯并二氧戊环-6-基
1-42	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H1-0	3-氯-5-(三氟甲基)苯基
1-43	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H2-S	3-氯-5-(三氟甲基)苯基
1-44	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H2-S	3-(三氟甲基)-1,2,4-三唑-1-基
1-45	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H2-S	4-(三氟甲基)咪唑-1-基
1-46	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H2-S	3-(三氟甲基)吡啶-1-基
1-47	CH ₂ CH ₃	2	H	H	H	N	H2-S	4-(三氟甲基)吡啶-1-基

- [0842] (表1)~(表2)中记载的本化合物的¹H-NMR数据如下所示。
- [0843] 本化合物1-8
- [0844] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 9.10-9.04 (2H, m), 8.56 (1H, d), 8.35 (1H, d), 8.16 (1H, d), 7.81 (1H, dd), 3.78 (2H, q), 1.42 (3H, t) .
- [0845] 本化合物1-9
- [0846] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.95 (1H, s), 8.57 (1H, d), 8.38 (1H, d), 8.14 (1H, dd), 7.80 (1H, s), 7.62 (1H, d), 3.03 (2H, q), 1.35 (3H, t) .
- [0847] 本化合物1-10
- [0848] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.94 (1H, s), 8.55-8.51 (2H, m), 8.16 (1H, dd), 8.05 (1H, d), 7.82 (1H, d), 3.69 (2H, q), 1.38 (3H, t) .
- [0849] 本化合物1-11
- [0850] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 9.11 (1H, d), 9.05 (1H, dd), 8.54 (1H, dd), 8.49 (1H, d), 8.21 (1H, dd), 7.75 (1H, dd), 3.75 (2H, q), 1.41 (3H, t) .
- [0851] 本化合物1-12
- [0852] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 9.05 (1H, dd), 8.54 (1H, dd), 8.36 (2H, d), 7.84 (2H, d), 7.74 (1H, dd), 3.76 (2H, q), 1.41 (3H, t) .
- [0853] 本化合物1-13
- [0854] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 9.06 (1H, d), 8.58-8.49 (2H, m), 8.42 (1H, d), 7.90 (1H, d), 7.78-7.70 (2H, m), 3.76 (2H, q), 1.41 (3H, t) .
- [0855] 本化合物1-14
- [0856] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 9.04 (1H, dd), 8.53 (1H, dd), 8.17 (1H, dd), 7.93 (1H, dd), 7.80-7.75 (2H, m), 7.73 (1H, dd), 3.75 (2H, q), 1.38 (3H, t) .
- [0857] 本化合物1-16
- [0858] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.64 (2H, s), 8.50 (1H, s), 8.16 (1H, s), 8.08 (1H, d), 8.02 (1H, d), 3.73 (2H, q), 1.43 (3H, t) .
- [0859] 本化合物1-17
- [0860] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 9.05 (1H, dd), 8.54 (1H, dd), 8.28 (2H, d), 7.85 (2H, d), 7.73 (1H, dd), 3.75 (2H, q), 1.40 (3H, t) .
- [0861] 本化合物1-18
- [0862] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.49 (1H, brs), 8.23 (2H, d), 8.06 (1H, dd), 8.02 (1H, d), 7.86 (2H, d), 3.77 (2H, q), 1.42 (3H, t) .
- [0863] 本化合物1-19
- [0864] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 9.08 (1H, dd), 8.63 (2H, s), 8.58 (1H, dd), 8.06 (1H, s), 7.84 (1H, dd), 3.75 (2H, q), 1.46 (3H, t) .
- [0865] 本化合物1-20
- [0866] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.60 (2H, s), 8.53 (1H, s), 8.13 (2H, s), 8.08 (1H, s), 3.73 (2H, q), 1.48 (3H, t) .
- [0867] 本化合物1-21
- [0868] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 9.30 (1H, dd), 8.79 (1H, dd), 8.70 (2H, s), 8.14 (1H, s), 3.80 (2H,

q), 1.46 (3H, t) .

[0869] 本化合物1-22

[0870] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.31 (1H, d) , 8.81 (1H, d) , 8.61 (2H, s) , 8.08 (1H, s) , 3.82 (2H, q) , 1.50 (3H, t) .

[0871] 本化合物1-23

[0872] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.61 (2H, s) , 8.27 (1H, dd) , 8.06 (1H, s) , 7.95 (1H, dd) , 7.90–7.85 (2H, m) , 3.68 (2H, q) , 1.44 (3H, t) .

[0873] 本化合物1-24

[0874] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.64 (2H, s) , 8.25–8.22 (1H, m) , 8.13 (1H, s) , 7.85–7.77 (3H, m) , 3.67 (2H, q) , 1.40 (3H, t) .

[0875] 本化合物1-25

[0876] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.05 (1H, dd) , 8.63 (2H, s) , 8.59 (1H, dd) , 8.09 (1H, s) , 7.80 (1H, dd) , 3.88 (2H, q) , 1.42 (3H, t) .

[0877] 本化合物1-26

[0878] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.06 (1H, dd) , 8.55 (1H, dd) , 8.33 (1H, s) , 8.12 (1H, d) , 7.76 (1H, dd) , 7.62 (1H, d) , 3.74 (2H, q) , 1.41 (3H, t) .

[0879] 本化合物1-27

[0880] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.06 (1H, dd) , 8.58 (1H, s) , 8.54 (1H, dd) , 8.44 (1H, d) , 8.03 (1H, s) , 7.76 (1H, dd) , 3.74 (2H, q) , 1.41 (3H, t) .

[0881] 本化合物1-28

[0882] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.06 (1H, dd) , 8.57–8.51 (2H, m) , 8.47–8.42 (1H, m) , 7.75 (1H, dd) , 7.44 (1H, dd) , 3.75 (2H, q) , 1.41 (3H, t) .

[0883] 本化合物1-29

[0884] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.08–9.04 (2H, m) , 8.60 (1H, s) , 8.55 (1H, dd) , 7.79 (1H, dd) , 7.75 (1H, dd) , 3.75 (2H, q) , 1.41 (3H, t) .

[0885] 本化合物1-30

[0886] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.64 (1H, d) , 9.14 (1H, d) , 9.07 (1H, dd) , 8.79–8.76 (1H, m) , 8.55 (1H, dd) , 7.77 (1H, dd) , 3.74 (2H, q) , 1.42 (3H, t) .

[0887] 本化合物1-31

[0888] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.07 (1H, dd) , 9.04 (1H, d) , 8.55 (1H, dd) , 8.48 (1H, s) , 8.28 (1H, dd) , 7.78 (1H, dd) , 3.72 (2H, q) , 1.42 (3H, t) .

[0889] 本化合物1-32

[0890] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.05 (1H, dd) , 8.56–8.52 (2H, m) , 8.38–8.34 (1H, m) , 7.93 (1H, d) , 7.74 (1H, dd) , 7.66 (1H, dd) , 3.77 (2H, q) , 1.41 (3H, t) .

[0891] 本化合物1-33

[0892] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.05 (1H, dd) , 8.56–8.51 (2H, m) , 8.23 (1H, dd) , 7.98 (1H, d) , 7.80 (1H, dd) , 3.77 (2H, q) , 1.40 (3H, t) .

[0893] 本化合物1-34

[0894] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.05 (1H, dd) , 8.54 (1H, dd) , 8.33–8.29 (2H, m) , 7.94–7.90 (1H,

m), 7.75 (1H, dd), 3.74 (2H, q), 1.41 (3H, t).

[0895] 本化合物1-35

[0896] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.04 (1H, dd), 8.53 (1H, dd), 7.80-7.72 (3H, m), 7.15-7.08 (1H, m), 3.75 (2H, q), 1.40 (3H, t).

[0897] 本化合物1-36

[0898] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.05 (1H, dd), 8.53 (1H, dd), 7.77 (1H, dd), 7.38 (1H, s), 4.41 (3H, s), 3.66 (2H, q), 1.40 (3H, t).

[0899] 本化合物1-37

[0900] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.04 (1H, dd), 8.53 (1H, dd), 7.96 (1H, dd), 7.74 (1H, dd), 7.56 (1H, dd), 3.74 (2H, q), 1.41 (3H, t).

[0901] 本化合物1-38

[0902] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.05 (1H, dd), 8.54 (1H, dd), 8.12 (2H, d), 7.74 (1H, dd), 7.62 (1H, dd), 3.74 (2H, q), 1.41 (3H, t).

[0903] 本化合物1-39

[0904] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.92 (1H, dd), 8.64 (1H, dd), 8.51 (2H, s), 8.05 (1H, s), 7.69 (1H, dd), 4.08 (2H, q), 1.44 (3H, t).

[0905] 本化合物1-41

[0906] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.04 (1H, dd), 8.53 (1H, dd), 7.84 (1H, d), 7.72 (1H, dd), 7.54 (1H, d), 6.19 (2H, s), 3.76 (2H, q), 1.42 (3H, t).

[0907] 本化合物1-42

[0908] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.06 (1H, dd), 8.54 (1H, dd), 8.41 (2H, d), 7.88 (1H, s), 7.75 (1H, dd), 3.74 (2H, q), 1.41 (3H, t).

[0909] 本化合物1-43

[0910] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.91 (1H, dd), 8.63 (1H, dd), 8.22 (2H, t), 7.78 (1H, s), 7.68 (1H, dd), 4.07 (2H, q), 1.43 (3H, t).

[0911] 本化合物1-44

[0912] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.21 (1H, d), 8.91 (1H, dd), 8.64 (1H, dd), 7.71 (1H, dd), 4.00 (2H, q), 1.43 (3H, t).

[0913] 本化合物1-45

[0914] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.90 (1H, td), 8.65 (1H, dt), 8.29 (1H, s), 7.97 (1H, d), 7.71 (1H, ddd), 4.00 (2H, q), 1.43 (3H, t).

[0915] 本化合物1-46

[0916] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.90 (1H, dd), 8.63 (1H, dd), 8.56 (1H, td), 7.67 (1H, dd), 6.81 (1H, d), 4.02 (2H, q), 1.41 (3H, t).

[0917] 本化合物1-47

[0918] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.90 (1H, dd), 8.78 (1H, d), 8.62 (1H, dd), 8.00 (1H, s), 7.67 (1H, dd), 4.01 (2H, q), 1.41 (3H, t).

[0919] 接着示出本发明防除剂的制剂例。此外,份表示重量份。

[0920] 制剂例1

[0921] 将本化合物1-1~1-47中的任1种10份溶解于二甲苯35份与DMF 35份的混合物,加入聚氧乙烯苯乙基苯基醚14份和十二烷基苯磺酸钙6份,混合,得到各自的乳剂。

[0922] 制剂例2

[0923] 将月桂基硫酸钠4份、木质素磺酸钙2份、合成含氢氧化硅微粉末20份和硅藻土54份混合,然后加入本化合物1-1~1-47中的任1种20份,混合,得到各自的水和剂。

[0924] 制剂例3

[0925] 在本化合物1-1~1-47中的任1种2份中加入合成含氢氧化硅微粉末1份、木质素磺酸钙2份、膨润土30份和高岭土粘土65份,混合。接着,在该混合物中加入适当量的水,然后搅拌,用造粒机造粒,通风干燥,得到各自的粒剂。

[0926] 制剂例4

[0927] 将本化合物1-1~1-47中的任1种1份溶解于适当量的丙酮,在其中加入合成含氢氧化硅微粉末5份、PAP(酸性磷酸异丙酯)0.3份和Fubasami粘土93.7份,充分搅拌混合,蒸发除去丙酮,得到各自的粉剂。

[0928] 制剂例5

[0929] 将聚氧乙烯烷基醚硫酸铵盐和白碳的混合物(重量比1:1)35份、本化合物1-1~1-47中的任1种10份和水55份混合,用湿式粉碎法进行微粉碎,由此得到各自的流动剂。

[0930] 制剂例6

[0931] 将本化合物1-1~1-47中的任1种0.1份溶解于二甲苯5份和三氯乙烷5份,将所得物混合于脱臭煤油89.9份,得到各自的油剂。

[0932] 制剂例7

[0933] 将本化合物1-1~1-47中的任1种10mg溶解于丙酮0.5ml,将该溶液与动物用固态饲料粉末(饲养繁殖用固态饲料粉末CE-2、日本CREA公司商品)5g进行处理,均匀混合。然后使丙酮蒸发干燥,得到各自的毒饵剂。

[0934] 制剂例8

[0935] 将本化合物1-1~1-47中的任1种0.1份、Neochiozol(中央化成公司)49.9份放入喷雾罐,装载喷雾阀后,填充二甲基醚25份、LPG25份,振荡,安装促动器,由此得到油剂喷雾。

[0936] 制剂例9

[0937] 将本化合物1-1~1-47中的任1种0.6份、BHT(2,6-二叔丁基-4-甲基苯酚)0.01份、二甲苯5份、脱臭灯油3.39份和乳化剂{RHEODOLMO-60(花王公司制)}1份混合溶解,将所得物与蒸馏水50份填充到容器,装载阀后,通过该阀加压填充喷射剂(LPG)40份,得到水性喷雾。

[0938] 制剂例10

[0939] 将本化合物1-1~1-47中的任1种0.1g溶解于丙二醇2ml,使其浸渗于4.0×4.0cm、厚度1.2cm的多孔陶瓷板,得到加热式烟熏剂。

[0940] 制剂例11

[0941] 将本化合物1-1~1-47中的任1种5份与乙烯-甲基丙烯酸甲酯共聚物(共聚物中的甲基丙烯酸甲酯的比例:10重量%,Acryft WD301、住友化学制)95份在密闭式加压捏合机(森山制作所制)中熔融混炼,将得到的混炼物由挤出成型机经由成型模具挤出,得到长度

15cm、直径3mm的棒状成型体。

[0942] 制剂例12

[0943] 将本化合物1-1~1-47中的任1种5份与软质氯乙烯树脂95份在密闭式加压捏合机(森山制作所制)中熔融混炼,将得到的混炼物由挤出成型机经由成型模具挤出,得到长度15cm、直径3mm的棒状成型体。

[0944] 制剂例13

[0945] 将本化合物1-1~1-47中的任1种100mg、乳糖68.75mg、玉米淀粉237.5mg、微晶性纤维素43.75mg、聚乙烯基吡咯烷酮18.75mg、羧甲基淀粉钠28.75mg和硬脂酸镁2.5mg混合,将得到的混合物压缩为适当的大小,得到片剂。

[0946] 制剂例14

[0947] 将本化合物1-1~1-47中的任1种25mg、乳糖60mg、玉米淀粉25mg、羧甲基纤维素钙6mg和5%羟基丙基甲基纤维素适量混合,将得到的混合物填充于硬壳明胶胶囊或羟基丙基甲基纤维素胶囊,得到胶囊剂。

[0948] 制剂例15

[0949] 在本化合物1-1~1-47中的任1种1000mg、富马酸500mg、氯化钠2000mg、对羟基苯甲酸甲酯150mg、对羟基苯甲酸丙酯50mg、颗粒糖25000mg、山梨糖醇(70%溶液)13000mg、VeegumK(Vanderbilt Co.)100mg、香料35mg和着色料500mg中加入蒸馏水使得最终容量达到100ml,混合,得到经口施与用混悬剂。

[0950] 制剂例16

[0951] 将本化合物1-1~1-47中的任1种5重量%溶解于聚山梨醇酯85 5重量%、苧基醇3重量%和丙二醇30重量%,以使该溶液的pH达到6.0~6.5的方式加入磷酸盐缓冲液后,加入水直至终容量,得到经口施与用液剂。

[0952] 制剂例17

[0953] 通过加热在分馏椰子油57重量%和聚山梨醇酯85 3重量%中分散二硬脂酸铝5重量%。将其冷却至室温,在其油状媒液中使糖精25份分散。在所得物中分配本化合物1-1~1-47中的任1种10重量%,得到经口施与用糊状制剂。

[0954] 制剂例18

[0955] 将本化合物1-1~1-47中的任1种5重量%与石灰石粉95重量%混合,使用湿润颗粒形成法得到经口施与用粒剂。

[0956] 制剂例19

[0957] 将本化合物1-1~1-47中的任1种5份溶解于二乙二醇单乙基醚80份,在所得物中混合碳酸亚丙酯15份,得到喷滴液剂。

[0958] 制剂例20

[0959] 将本化合物1-1~1-47中的任1种10份溶解于二乙二醇单乙基醚70份,在所得物中混合2-辛基十二烷醇20份,得到浇泼液剂。

[0960] 制剂例21

[0961] 在本化合物1-1~1-47中的任1种0.5份中添加NIKKOL TEALS-42(日光化学、月桂基硫酸三乙醇胺的42%水溶液)60份、丙二醇20份,充分搅拌混合直至得到均匀溶液后,加入水19.5份,然后充分搅拌混合,得到均匀溶液的洗发剂。

[0962] 制剂例22

[0963] 将由本化合物1-1~1-47中的任1种0.15重量%、动物饲料95重量%、以及第2磷酸钙、硅藻土、Aerosil和碳酸酯(或粉笔)构成的混合物4.85重量%充分搅拌混合,得到动物用预混合饲料。

[0964] 制剂例23

[0965] 将本化合物1-1~1-47中的任1种7.2g和Hosco(注册商标)S-55(丸石制药公司制)92.8g在100℃溶解混和,注入栓剂模具,冷却固化,得到栓剂。

[0966] 接着,通过试验例示出本发明防除剂的有害节肢动物防除效力。

[0967] 试验例1

[0968] 由制剂例5得到的化合物1-7、1-8、1-15、1-19、1-23~1-26、1-28~1-30、1-33~1-34、1-36、1-38或1-42~1-43的制剂用水稀释至各化合物的浓度达到500ppm,然后加入Sindain(住友化学制)使其稀释3000倍,得到稀释液。

[0969] 另一方面,在植入到塑料杯中的黄瓜幼苗(第1真叶展开期)接种绵蚜(Aphisgossypii)(全阶段)约30只,放置1天。在该幼苗上喷洒该稀释液20ml。

[0970] 喷洒6天后,调查在该黄瓜的叶上寄生的绵蚜生存虫数,通过以下的公式求出防除值。

[0971] 防除值(%) = $\{1 - (Cb \times Tai) / (Cai \times Tb)\} \times 100$

[0972] 此外,式中的文字表示以下的含义。

[0973] Cb:无处理区的处理前的虫数

[0974] Cai:无处理区的观察时的寄生生存虫数

[0975] Tb:处理区的处理前的虫数

[0976] Tai:处理区的观察时的寄生生存虫数

[0977] 在此,无处理区是指,将制剂例5中不含本化合物的制剂用与处理区等量的水稀释后的液体喷洒后的区域。

[0978] 结果,化合物1-7、1-8、1-15、1-19、1-23~1-26、1-28~1-30、1-33~1-34、1-36、1-38或1-42~1-43的处理区分别示出90%以上的防除值。

[0979] 试验例2

[0980] 将由制剂例5得到的化合物1-24的制剂以各化合物的浓度达到500ppm的方式用水稀释,得到稀释液。

[0981] 另一方面,在植入到塑料杯中的黄瓜幼苗(第2真叶展开期)的植株根部灌注该稀释液5ml,在25℃温室内保持7天。将绵蚜(Aphisgossypii)(全阶段)约30只接种于黄瓜叶面,进一步在该温室内保持6天后,调查在该黄瓜的叶上寄生的绵蚜生存虫数,通过以下的公式求出防除值。

[0982] 防除值(%) = $\{1 - (Cb \times Tai) / (Cai \times Tb)\} \times 100$

[0983] 此外,式中的文字表示以下的含义。

[0984] Cb:无处理区的虫接种时的虫数

[0985] Cai:无处理区的观察时的寄生生存虫数

[0986] Tb:处理区的虫接种时的虫数

[0987] Tai:处理区的观察时的寄生生存虫数

[0988] 在此,无处理区是指,将制剂例5中不含本化合物的制剂用与处理区等量的水稀释后的液体喷洒后的区域。

[0989] 结果,化合物1-24的处理区显示出90%以上的防除值。

[0990] 试验例3

[0991] 将由制剂例5得到的本化合物的制剂以化合物的浓度达到500ppm的方式用水稀释,然后加入Sindain(住友化学制)以进行3000倍稀释,得到稀释液。

[0992] 在聚乙烯杯中种植的第2片叶展开期的稻子幼苗上喷洒该稀释液10ml。风干后,放入20只褐飞虱(*Nilaparvata lugens*)的3龄幼虫,在25℃的温室内保管。调查6天后在稻子上寄生的褐飞虱的生存虫数,通过下式求出死虫率。

[0993] 死虫率(%) = (1-生存虫数/20) × 100

[0994] 在此,无处理区是指,将制剂例5中不含本化合物的制剂用与处理区等量的水稀释后的液体喷洒后的区域。

[0995] 结果,本化合物的处理区可确认到防除效力。

[0996] 试验例4

[0997] 将由制剂例5得到的化合物1-15的制剂以化合物的浓度达到500ppm的方式用水稀释,得到稀释液。

[0998] 另一方面,在植入到塑料杯中的稻幼苗播种2周后,第2叶展开期)的植株根部灌注该稀释液5ml,在25℃温室内保持7天。放入20只褐飞虱(*Nilaparvata lugens*)的3龄幼虫,进一步在该温室内保持6天后,调查在该稻的叶上寄生的褐飞虱生存虫数,通过下式求出死虫率。

[0999] 死虫率(%) = (1-生存虫数/20) × 100

[1000] 在此,无处理区是指,将制剂例5中不含本化合物的制剂用与处理区等量的水稀释后的液体喷洒后的区域。

[1001] 结果,化合物1-15的处理区显示出90%以上的死虫率。

[1002] 试验例5

[1003] 将由制剂例5得到的本化合物的制剂以化合物的浓度达到500ppm的方式用水稀释,然后加入Sindain(住友化学制)以进行3000倍稀释,得到稀释液。

[1004] 另一方面,在聚乙烯杯中种植的马铃薯幼苗(第3片真叶展开期)放入烟粉虱(*Bemisia tabaci*)成虫,使其产卵约72小时。将该马铃薯苗在温室内保持8天,从产下的卵到孵化幼虫期间以20ml/杯的比例喷洒该稀释液,在25℃在温室内保持。进行7天后马铃薯叶上的生存幼虫数的调查,通过下式求出防除值。

[1005] 防除值(%) = {1- (Cb×Tai) / (Cai×Tb)} × 100

[1006] 此外,式中的文字表示以下的含义。

[1007] Cb:无处理区的处理前的幼虫数

[1008] Cai:无处理区的观察时的生存幼虫数

[1009] Tb:处理区的处理前的幼虫数

[1010] Tai:处理区的观察时的生存幼虫数

[1011] 在此,无处理区是指,将制剂例5中不含本化合物的制剂用与处理区等量的水稀释后的液体喷洒后的区域。

[1012] 结果,本化合物的处理区可确认到防除效力。

[1013] 试验例6

[1014] 将由制剂例5得到的本化合物1-5、1-8、1-11~1-16、1-19、1-21~1-22、1-24~1-25、1-33~1-36、1-38~1-39、1-42~1-43或1-46~1-47的制剂以各化合物的浓度达到500ppm的方式用水稀释,然后加入Sindain(住友化学制)以进行3000倍稀释得到稀释液。

[1015] 另一方面,在聚乙烯杯中种植的3叶期卷心菜上以20mL/杯的比例喷洒该稀释液。喷洒后风干植物,切取茎叶部并收纳于50mL杯,放入小菜蛾(*Plutella xylostella*)2龄幼虫5只,盖上盖子。在25℃保管,在5天后数出死亡虫数,通过下式求出死虫率。

[1016] 死虫率(%) = {(供试虫数-生存虫数)/供试虫数} × 100

[1017] 结果,化合物1-5、1-8、1-11~1-16、1-19、1-21~1-22、1-24~1-25、1-33~1-36、1-38~1-39、1-42~1-43或1-46~1-47的处理区分别显示出80%以上的死虫率。

[1018] 试验例7

[1019] 将由制剂例5得到的化合物1-4~1-5、1-7~1-8、1-11~1-16、1-19~1-21或1-23~1-25的制剂以各化合物的浓度达到500ppm的方式用水稀释,然后加入Sindain(住友化学制)以进行3000倍稀释,得到稀释液。

[1020] 另一方面,在塑料杯中种植苹果,使其生长至第7片真叶至第8片真叶展开。在苹果上以20mL/杯的比例喷洒该稀释液。喷洒后风干植物,放入苹果卷蛾(*Adoxophyes orana fasciata*)初龄幼虫60只,将挖通底面且贴有滤纸的塑料杯倒置覆盖。在7天后数出死亡虫数,通过下式求出死虫率。

[1021] 死虫率(%) = {(供试虫数-生存虫数)/供试虫数} × 100

[1022] 结果,化合物1-4~1-5、1-7~1-8、1-11~1-16、1-19~1-21或1-23~1-25的处理区分别显示出90%以上的死虫率。

[1023] 试验例8

[1024] 将由制剂例5得到的本化合物的制剂以化合物的浓度达到500ppm的方式用水稀释,得到稀释液。

[1025] 在直径5.5cm的聚乙烯杯的底部铺上等大的滤纸,将该稀释液0.7ml滴在滤纸上,均匀地放入蔗糖30mg作为饵料。在该聚乙烯杯内放入家蝇(*Musca domestica*)雌成虫10只,盖上盖子。在24小时后调查家蝇的生死,数出死亡虫数,通过下式求出死虫率。

[1026] 死虫率(%) = (死亡虫数/供试虫数) × 100

[1027] 结果,本化合物的处理区可确认到防除效力。

[1028] 试验例9

[1029] 将由制剂例5得到的化合物1-6或1-24的制剂以各化合物的浓度达到500ppm的方式用水稀释,得到稀释液。

[1030] 在直径5.5cm的聚乙烯杯的底部铺上等大的滤纸,将该稀释液0.7ml滴在滤纸上,均匀地放入蔗糖30mg作为饵料。在该聚乙烯杯内放入德国小蠊(*Blattella germanica*)雄成虫2只,盖上盖子。在6天后调查德国小蠊的生死,数出死亡虫数,通过下式求出死虫率。

[1031] 死虫率(%) = (死亡虫数/供试虫数) × 100

[1032] 结果,化合物1-6或1-24的处理区分别显示出100%的死虫率。

[1033] 试验例10

[1034] 将由制剂例5得到的化合物1-13、1-15、1-19、1-24~1-25、1-39或1-42~1-43的制剂以各化合物的浓度达到500ppm的方式用水稀释,得到稀释液。

[1035] 将该稀释液0.7ml加入离子交换水100ml(有效成分浓度3.5ppm)。在该液中加入淡色库蚊(*Culex pipiens pallens*)终龄幼虫20只,在1天后调查其生死并数出死亡虫数,求出死虫率。

[1036] 死虫率(%) = (死亡虫数/供试虫数) × 100

[1037] 结果,化合物1-13、1-15、1-19、1-24~1-25、1-39或1-42~1-43的处理区分别显示出95%以上的死虫率。

[1038] 试验例11

[1039] 在螺纹瓶(maruemu No.5;27×55mm)中量取化合物1-6、1-10、1-15、1-24或1-37~1-38各2mg,加入丙酮0.2mL,盖上盖子,溶解。使螺纹瓶旋转、反转,以使在内壁整体均匀的方式涂布药液。取下盖子,使其风干约2小时后,放入长角血蜱(*Haemaphysalis longicornis*)未吸血蜱幼虫1群5只并盖上盖子。在2天后数出死亡虫数,通过下式算出死虫率。

[1040] 死虫率(%) = 100 × (死亡虫数/供试虫数)

[1041] 结果,化合物1-6、1-10、1-15、1-24或1-37~1-38的处理区分别显示出100%的死虫率。

[1042] 试验例12

[1043] 将由制剂例1得到的化合物1-15、1-19、1-25、1-39、1-42或1-44~1-45的制剂以化合物的浓度达到500ppm的方式用水稀释,然后加入Sindain(住友化学制)以进行3000倍稀释得到稀释液。

[1044] 另一方面,在塑料杯中种植的3叶期黄瓜以30mL/杯的比例喷洒该稀释液。喷洒后风干植物,切取第2叶并收纳于200mL杯,放入黄守瓜(*Aulacophora femoralis*)2龄幼虫10只,盖上盖子。在25℃保管,在5天后数出死亡虫数,通过下式求出死虫率。

[1045] 死虫率(%) = (死亡虫数/供试虫数) × 100

[1046] 结果,化合物1-15、1-19、1-25、1-39、1-42或1-44~1-45的处理区分别显示出80%以上的死虫率。

[1047] 试验例13

[1048] 将由制剂例1得到的本化合物的制剂以化合物的浓度达到500ppm的方式用水稀释,得到稀释液。

[1049] 另一方面,按照Pleau等的顺序(*Entomologia Experimentalis et Applicata* 105:1-11,2002)准备玉米根虫(*Diabrotica virgifera virgifera*)用的人工饲料,在24孔微孔板(Becton Dickinson制)的各孔内加入2mL。将该稀释液以40μL/孔的比例对人工饲料表面进行喷洒处理,人工饲料干燥后,在每1个孔放5只玉米根虫(*Diabrotica virgifera virgifera*)初龄幼虫,覆盖封口膜(Bemis Company制),盖上盖子。在25℃保管,在处理3天后数出死亡虫数,通过下式求出死虫率。

[1050] 死虫率(%) = (死亡虫数/供试虫数) × 100

[1051] 结果,在本化合物的处理区可确认到防除效力。

[1052] 产业上的可利用性

[1053] 本发明防除剂对有害节肢动物具有防除效力,作为有害节肢动物防除剂的有效成分有用。