



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 118974022 A

(43) 申请公布日 2024. 11. 15

(21) 申请号 202380030627.9

(22) 申请日 2023.03.23

(30) 优先权数据

2022-051061 2022.03.28 JP

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2024.09.26

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/JP2023/011457 2023.03.23

(87) PCT国际申请的公布数据

W02023/190015 JA 2023.10.05

(71) 申请人 日本农药株式会社

地址 日本东京都

(72) 发明人 藤田直弥 田中绫介 米村树

三次启介 及川桧 横井大贵

山田高之

(74) 专利代理机构 北京市柳沈律师事务所

11105

专利代理师 王珂

(51) Int. Cl.

C07D 237/24 (2006.01)

A01N 43/58 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

A61K 31/50 (2006.01)

A61K 31/501 (2006.01)

A61P 33/00 (2006.01)

C07D 401/04 (2006.01)

C07D 401/14 (2006.01)

权利要求书11页 说明书76页

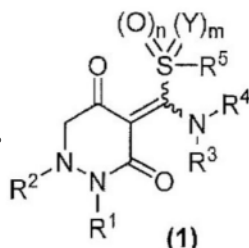
(54) 发明名称

1-芳基四氢吡嗪-3,5-二酮衍生物或其盐类
和含有该化合物的杀虫剂及其使用方法

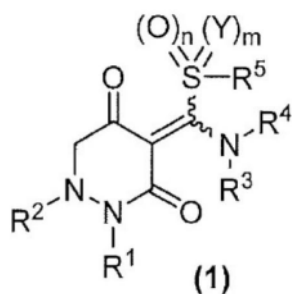
(57) 摘要

在农业和园艺等的作物生产中,由害虫等引起的损害目前仍然很大,由于对现有药的抗药性害虫的产生等因素,因此期望新型的农艺园艺用杀虫剂的开发。本发明发现通式(1)表示的化合物或其盐类{式中, R^1 表示烷氧基羰基等, R^2 表示取代苯基等, R^3 表示氢原子等, R^4 表示取代苯基等, R^5 表示烷基等,Y表示氧原子等,m和n表示0或1},对农艺园艺领域的害虫等显示出较高的杀虫效果,并提供将其作为有效成分的农艺园艺用杀

虫剂以及其使用方法。



1. 一种通式 (1) 表示的化合物或其盐类，
[化学式1]



式中，

R^1 表示 (a1) 氢原子；(a2) (C_1-C_6) 烷基；(a3) (C_2-C_6) 烯基；(a4) (C_2-C_6) 炔基；(a5) (C_3-C_6) 环烷基；(a6) 卤代 (C_1-C_6) 烷基；(a7) 卤代 (C_3-C_6) 环烷基；(a8) (C_1-C_6) 烷氧基；(a9) 在链上具有分别独立地选自氰基、 (C_1-C_6) 烷氧基和 (C_3-C_6) 环烷基的 1~3 个取代基的取代 (C_1-C_6) 烷基；(a10) 具有分别独立地选自氰基、 (C_1-C_6) 烷基和 (C_1-C_6) 烷氧基的 1~3 个取代基的取代 (C_3-C_6) 环烷基；(a11) (C_1-C_6) 烷基羰基；(a12) 卤代 (C_1-C_6) 烷基羰基；(a13) (C_3-C_6) 环烷基羰基；(a14) (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷基羰基；(a15) (C_1-C_6) 烷基巯基 (C_1-C_6) 烷基羰基；(a16) 苯基羰基；(a17) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基和 (C_1-C_6) 烷氧基的 1~5 个取代基的取代苯基羰基；(a18) 噻吩基羰基；(a19) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基和 (C_1-C_6) 烷氧基的 1~3 个取代基的取代噻吩基羰基；(a20) 噻唑基羰基；(a21) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基和 (C_1-C_6) 烷氧基的 1~2 个取代基的取代噻唑基羰基；(a22) (C_1-C_6) 烷氧基羰基；(a23) 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基羰基；(a24) (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷氧基羰基；(a25) (C_1-C_6) 烷基巯基 (C_1-C_6) 烷氧基羰基；(a26) (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷氧基羰基；(a27) (C_2-C_6) 烯氧基羰基；(a28) (C_2-C_6) 炔氧基羰基；(a29) (C_3-C_6) 环烷氧基羰基；(a30) 苯氧基羰基；(a31) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基和 (C_1-C_6) 烷基的 1~5 个取代基的取代苯氧基羰基；(a32) 苯基 (C_1-C_6) 烷氧基羰基；(a33) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基和 (C_1-C_6) 烷基的 1~5 个取代基的取代苯基 (C_1-C_6) 烷氧基羰基；(a34) 氨基羰基；(a35) N- (C_1-C_6) 烷基氨基羰基；(a36) N,N-二 (C_1-C_6) 烷基氨基羰基，该基团中 (C_1-C_6) 烷基任选相同或不同；(a37) N-卤代 (C_1-C_6) 烷基氨基羰基；(a38) N- (C_2-C_6) 烯基氨基羰基；(a39) N- (C_2-C_6) 炔基氨基羰基；(a40) N- (C_1-C_6) 烷基-N- (C_2-C_6) 炔基氨基羰基；(a41) N- (C_3-C_6) 环烷基氨基羰基；(a42) N- (C_1-C_6) 烷氧基氨基羰基；(a43) N- (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷基氨基羰基；(a44) N- (C_1-C_6) 烷基巯基 (C_1-C_6) 烷基氨基羰基；(a45) N-苯基 (C_1-C_6) 烷基氨基羰基；(a46) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基和 (C_1-C_6) 烷基的 1~5 个取代基的 N-取代苯基 (C_1-C_6) 烷基氨基羰基；(a47) 吡咯烷基羰基；(a48) N- (C_1-C_6) 烷基胍基羰基；(a49) N,N-二 (C_1-C_6) 烷基胍基羰基，该基团中 (C_1-C_6) 烷基任选相同或不同；(a50) N-苯基氨基羰基；(a51) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基和 (C_1-C_6) 烷基的 1~5 个取代基的 N-取代苯基氨基羰基；(a52) (C_1-C_6) 烷基磺酰基；(a53) 卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基；(a54) N- (C_1-C_6) 烷基氨基磺酰基；(a55) N-卤代 (C_1-C_6) 烷基氨基磺酰基；(a56) (C_1-C_6) 烷基硫羰基；(a57) 卤代 (C_1-C_6) 烷基硫羰基；(a58) (C_3-C_6) 环烷基硫羰基；(a59) (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷基硫羰基；(a60) (C_1-C_6) 烷基硫代 $(C_1-$

C₆) 烷基硫羰基; (a61) (C₁-C₆) 烷氧基硫羰基; (a62) 卤代 (C₁-C₆) 烷氧基硫羰基; (a63) 吡咯烷基硫羰基; (a64) 苯基硫羰基; (a65) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基和 (C₁-C₆) 烷基的1~5个取代基的取代苯基硫羰基; (a66) 苯氧基硫羰基; (a67) 苯基 (C₁-C₆) 烷基硫羰基; (a68) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基和 (C₁-C₆) 烷基的1~5个取代基的取代苯基 (C₁-C₆) 烷基硫羰基; (a69) N- (C₁-C₆) 烷基氨基硫羰基; (a70) N- 卤代 (C₁-C₆) 烷基氨基硫羰基; (a71) N, N- 二 (C₁-C₆) 烷基氨基硫羰基, 该基团中 (C₁-C₆) 烷基任选相同或不同; (a72) N- (C₂-C₆) 烯基氨基硫羰基; (a73) N- (C₂-C₆) 炔基氨基硫羰基; (a74) N- (C₁-C₆) 烷基-N- (C₂-C₆) 炔基氨基硫羰基; (a75) N- (C₁-C₆) 烷基巯基 (C₁-C₆) 烷基氨基硫羰基; (a76) N- (C₃-C₆) 环烷基氨基硫羰基; (a77) N- (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基氨基硫羰基; (a78) N- 苯基氨基硫羰基; (a79) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基和 (C₁-C₆) 烷基的1~5个取代基的取代N- 苯基氨基硫羰基; (a80) N- 苯基 (C₁-C₆) 烷基氨基硫羰基; (a81) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基和 (C₁-C₆) 烷基的1~5个取代基的取代N- 苯基 (C₁-C₆) 烷基氨基硫羰基; (a82) 苯基 (C₁-C₆) 烷基; (a83) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、(C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷基和 (C₁-C₆) 烷氧基的1~5个取代基的取代苯基 (C₁-C₆) 烷基; (a84) 噻唑基 (C₁-C₆) 烷基; (a85) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、(C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷基和 (C₁-C₆) 烷氧基的1~2个取代基的取代噻唑基 (C₁-C₆) 烷基; (a86) 苯基磺酰基; 或 (a87) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、(C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷基和 (C₁-C₆) 烷氧基的1~5个取代基的取代苯基磺酰基,

R²表示 (b1) 芳基; (b2) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1个以上的取代基的取代芳基; (b3) 5~10元环杂环基; 或 (b4) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1个以上的取代基的取代5~10元环杂环基,

R³表示 (c1) 氢原子; (c2) (C₁-C₆) 烷基; (c3) (C₃-C₆) 环烷基; (c4) (C₁-C₆) 烷氧基; (c5) (C₁-C₆) 烷基羰基; 或 (c6) (C₁-C₆) 烷氧基羰基,

R⁴表示 (d1) (C₁-C₆) 烷基; (d2) (C₂-C₆) 烯基; (d3) (C₂-C₆) 炔基; (d4) (C₃-C₆) 环烷基; (d5) 卤代 (C₁-C₆) 烷基; (d6) 卤代 (C₂-C₆) 烯基; (d7) 卤代 (C₂-C₆) 炔基; (d8) 卤代 (C₃-C₆) 环烷基; (d9) 具有分别独立地选自取代基组B的1~3个取代基的取代 (C₁-C₆) 烷基; (d10) 在环上具有分别独立地选自取代基组C的1~3个取代基的取代 (C₃-C₆) 环烷基; (d11) N, N- 二 (C₁-C₆) 烷基氨基, 该基团中 (C₁-C₆) 烷基任选相同或不同; (d12) N- (C₁-C₆) 烷基-N- 苯基氨基; (d13) (C₁-C₆) 烷基磺酰基; (d14) N- (C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基; (d15) 哌啶基; (d16) 吗啉基; (d17) 苯基; (d18) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~5个取代基的取代苯基; (d19) 吡啶基; (d20) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~4个取代基的取代吡啶基; (d21) 哒嗪基; (d22) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代哒嗪基; (d23) 嘧啶基; (d24) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代嘧啶基; (d25) 吡嗪基; (d26) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代吡嗪基; (d27) 三嗪基; (d28) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~2个取代基的取代三嗪基; (d29) 呋喃基; (d30) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代呋喃基; (d31) 噁唑基; (d32) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~2个取代基的取代噁唑基; (d33) 异噁唑基; (d34) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~2个取代基的取代异噁唑基; (d35) 噻吩基; (d36) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代噻吩基; (d37)

噻唑基; (d38) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~2个取代基的取代噻唑基; (d39) 异噻唑基; (d40) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~2个取代基的取代异噻唑基; (d41) 噻二唑基; (d42) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1个取代基的取代噻二唑基; (d43) 吡唑基; (d44) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代吡唑基; (d45) 三唑基; (d46) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~2个取代基的取代三唑基; (d47) 四唑基; (d48) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1个取代基的取代四唑基; (d49) 苯并噁唑基; (d50) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~4个取代基的取代苯并噁唑基; (d51) 苯并噻唑基; (d52) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~4个取代基的取代苯并噻唑基; (d53) 喹啉基; (d54) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~6个取代基的取代喹啉基; (d55) 萘基; (d56) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~7个取代基的取代萘基; (d57) 四氢萘基; (d58) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~10个取代基的取代四氢萘基; (d59) 苯基 (C_1-C_6) 烷基; (d60) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~5个取代基的取代苯基 (C_1-C_6) 烷基; (d61) 吡啶基 (C_1-C_6) 烷基; (d62) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~4个取代基的取代吡啶基 (C_1-C_6) 烷基; (d63) 吡嗪基 (C_1-C_6) 烷基; (d64) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代吡嗪基 (C_1-C_6) 烷基; (d65) 嘧啶基 (C_1-C_6) 烷基; (d66) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代嘧啶基 (C_1-C_6) 烷基; (d67) 咪唑基 (C_1-C_6) 烷基; (d68) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代咪唑基 (C_1-C_6) 烷基; (d69) 噻吩基 (C_1-C_6) 烷基; 或 (d70) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代噻吩基 (C_1-C_6) 烷基,

R^3 和 R^4 任选彼此键合而形成环,

R^5 表示 (e1) (C_1-C_6) 烷基; (e2) (C_2-C_6) 烯基; (e3) (C_2-C_6) 炔基; (e4) (C_3-C_6) 环烷基; (e5) 卤代 (C_1-C_6) 烷基; (e6) 卤代 (C_2-C_6) 烯基; (e7) 卤代 (C_2-C_6) 炔基; (e8) 卤代 (C_3-C_6) 环烷基; (e9) 在链上具有分别独立地选自氰基、(C_1-C_6) 烷氧基、(C_3-C_6) 环烷基、(C_1-C_6) 烷基羰基、(C_3-C_6) 环烷基羰基、苯基羰基、(C_1-C_6) 烷氧基羰基、氨基羰基、卤代 (C_1-C_6) 烷基羰基、(C_1-C_6) 烷基巯基、三 (C_1-C_6) 烷基甲硅烷基 (C_1-C_6) 烷氧基和三 (C_1-C_6) 烷基甲硅烷基的1~3个取代基的取代 (C_1-C_6) 烷基, 所述三 (C_1-C_6) 烷基甲硅烷基 (C_1-C_6) 烷氧基和所述三 (C_1-C_6) 烷基甲硅烷基各自中 (C_1-C_6) 烷基任选相同或不同; (e10) 具有分别独立地选自氰基、(C_1-C_6) 烷基和 (C_1-C_6) 烷氧基的1~3个取代基的取代 (C_3-C_6) 环烷基; (e11) 苯基 (C_1-C_6) 烷基; (e12) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C_1-C_6) 烷基、(C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、(C_3-C_6) 环烷基、(C_1-C_6) 烷氧基羰基、(C_1-C_6) 烷基巯基、(C_1-C_6) 烷基亚磺酰基、(C_1-C_6) 烷基磺酰基、卤代 (C_1-C_6) 烷基巯基、二苯基氨基、苯氧基和相邻的2个取代基一起形成的亚甲基二氧基的1~5个取代基的取代苯基 (C_1-C_6) 烷基; (e13) 吡啶基 (C_1-C_6) 烷基; (e14) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C_1-C_6) 烷基、(C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、(C_1-C_6) 烷氧基羰基和卤代 (C_1-C_6) 烷基巯基的1~4个取代基的取代吡啶基 (C_1-C_6) 烷基; (e15) 噻唑基 (C_1-C_6) 烷基; (e16) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C_1-C_6) 烷基、(C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、(C_1-C_6) 烷氧基羰基和卤代 (C_1-C_6) 烷基巯基的1~2个取代基的取代噻唑基 (C_1-C_6) 烷基; (e17) 噁二唑 (C_1-C_6) 烷基; (e18) 在环上具有吡啶基的取代噁二唑 (C_1-C_6) 烷基; (e19) 萘基 (C_1-C_6) 烷基; (e20) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C_1-

C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基和卤代 (C_1-C_6) 烷基巯基的1~7个取代基的取代萘基 (C_1-C_6) 烷基; (e21) 喹啉基 (C_1-C_6) 烷基; (e22) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基和卤代 (C_1-C_6) 烷基巯基的1~6个取代基的取代喹啉基 (C_1-C_6) 烷基; (e23) 噻吩基 (C_1-C_6) 烷基; (e24) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基和卤代 (C_1-C_6) 烷基巯基的1~3个取代基的取代噻吩基 (C_1-C_6) 烷基; (e25) 吡唑基 (C_1-C_6) 烷基; (e26) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基和卤代 (C_1-C_6) 烷基巯基的1~3个取代基的取代吡唑基 (C_1-C_6) 烷基; (e27) 噁唑基 (C_1-C_6) 烷基; (e28) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基和卤代 (C_1-C_6) 烷基巯基的1或2个取代基的取代噁唑基 (C_1-C_6) 烷基; (e29) 咪唑基 (C_1-C_6) 烷基; (e30) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基和卤代 (C_1-C_6) 烷基巯基的1~3个取代基的取代咪唑基 (C_1-C_6) 烷基; (e31) 吡啶基; (e32) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基和卤代 (C_1-C_6) 烷基巯基的1~4个取代基的取代吡啶基; (e33) 苯基; (e34) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基和卤代 (C_1-C_6) 烷基巯基的1~5个取代基的取代苯基; (e35) (C_1-C_6) 烷基羰基; 或 (e36) 氢原子,

R^3 和 R^5 任选彼此键合而形成5~6元环,

Y表示氧原子、或 NR^6 , 式中, R^6 表示氢原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷基羰基、卤代 (C_1-C_6) 烷基羰基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基、苯基磺酰基或在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基和 (C_1-C_6) 烷基的1~5个取代基的苯基磺酰基,

m表示0或1,

n表示0或1,

取代基组A包含: (f1) 卤素原子; (f2) 氰基; (f3) 硝基; (f4) 羟基; (f5) 羧基; (f6) (C_1-C_6) 烷基; (f7) (C_2-C_6) 烯基; (f8) (C_2-C_6) 炔基; (f9) (C_1-C_6) 烷氧基; (f10) (C_3-C_6) 环烷基; (f11) (C_1-C_6) 烷基巯基; (f12) (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基; (f13) (C_1-C_6) 烷基磺酰基; (f14) 卤代 (C_1-C_6) 烷基; (f15) 卤代 (C_2-C_6) 烯基; (f16) 卤代 (C_2-C_6) 炔基; (f17) 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基; (f18) 卤代 (C_3-C_6) 环烷基; (f19) 卤代 (C_1-C_6) 烷基巯基; (f20) 卤代 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基; (f21) 卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基; (f22) N,N-二 (C_1-C_6) 烷基氨基磺酰基, 该基团中 (C_1-C_6) 烷基任选相同或不同; (f23) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基和 (C_1-C_6) 烷基羰基的1~3个取代基的取代 (C_3-C_6) 环烷基; (f24) SF_5 基; (f25) (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷基; (f26) (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷氧基; (f27) (C_1-C_6) 烷基羰基氨基; (f28) 卤代 (C_1-C_6) 烷基羰基氨基; (f29) (C_1-C_6) 烷基磺酰基氨基; (f30) 卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基氨基; (f31) (C_1-C_6) 烷氧基羰基; (f32) 相邻的2个取代基一起形成的、任选取代有选自卤素原子、苯基和 (C_1-C_6) 烷基的亚甲基二氧基; (f33) (C_1-C_6) 烷基氨基羰基; (f34) N-卤代 (C_1-C_6) 烷基

氨基羰基; (f35) 呋喃基; (f36) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 ~ 3 个取代基的取代呋喃基; (f37) 噁唑基; (f38) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 ~ 2 个取代基的取代噁唑基; (f39) 异噁唑基; (f40) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 ~ 2 个取代基的取代异噁唑基; (f41) 噁二唑基; (f42) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_3-C_6) 环烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 个取代基的取代噁二唑基; (f43) 噻吩基; (f44) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_3-C_6) 环烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 ~ 3 个取代基的取代噻吩基; (f45) 噻唑基; (f46) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 ~ 2 个取代基的取代噻唑基; (f47) 异噻唑基; (f48) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 ~ 2 个取代基的取代异噻唑基; (f49) 噻二唑基; (f50) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 个取代基的取代噻二唑基; (f51) 吡咯基; (f52) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 ~ 3 个取代基的取代吡咯基; (f53) 吡唑基; (f54) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 ~ 2 个取代基的取代吡唑基; (f55) 咪唑基; (f56) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 ~ 2 个取代基的取代咪唑基; (f57) 三唑基; (f58) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 个取代基的取代三唑基; (f59) 四唑基; (f60) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 个取代基的取代四唑基; (f61) 噁唑啉基; (f62) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 ~ 4 个取代基的取代噁唑啉基; (f63) 噻唑啉基; (f64) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 ~ 4 个取代基的取代噻唑啉基; (f65) 异噁唑啉基; (f66) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 ~ 4 个取代基的取代异噁唑啉基; (f67) 异噻唑啉基; (f68) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 ~ 4 个取代基的取代异噻唑啉基; (f69) 吡咯烷基; (f70) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 ~ 4 个取代基的取代吡咯烷基; (f71) 咪唑啉基; (f72) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 ~ 4 个取代基的取代咪唑啉基; (f73) 苯基; (f74) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_3-C_6) 环烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6) 烷氧基的 1 ~ 5 个取代基的取代苯基; (f75) 吡啶基; (f76) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和卤代 (C_1-C_6)

C₆) 烷氧基的1~4个取代基的取代吡啶基; (f77) 哒嗪基; (f78) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代(C₁-C₆) 烷基和卤代(C₁-C₆) 烷氧基的1~3个取代基的取代哒嗪基; (f79) 嘧啶基; (f80) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代(C₁-C₆) 烷基和卤代(C₁-C₆) 烷氧基的1~3个取代基的取代嘧啶基; (f81) 吡嗪基; (f82) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代(C₁-C₆) 烷基和卤代(C₁-C₆) 烷氧基的1~3个取代基的取代吡嗪基; (f83) 三嗪基; (f84) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代(C₁-C₆) 烷基和卤代(C₁-C₆) 烷氧基的1~2个取代基的取代三嗪基; (f85) 二氢呋喃基; (f86) 二氢吡喃基; (f87) 苯氧基; (f88) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代(C₁-C₆) 烷基和卤代(C₁-C₆) 烷氧基的1~5个取代基的取代苯氧基; (f89) 苯基(C₁-C₆) 烷氧基; (f90) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代(C₁-C₆) 烷基和卤代(C₁-C₆) 烷氧基的1~5个取代基的取代苯基(C₁-C₆) 烷氧基; (f91) 苯基(C₁-C₆) 烷基硫基; (f92) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代(C₁-C₆) 烷基和卤代(C₁-C₆) 烷氧基的1~5个取代基的取代苯基(C₁-C₆) 烷基硫基; (f93) R⁶-(R⁷-N=)O=S基, 式中, R⁶表示(C₁-C₆) 烷基、(C₃-C₆) 环烷基、卤代(C₁-C₆) 烷基或(C₁-C₆) 烷氧基(C₁-C₆) 烷基, R⁷表示氢原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₃-C₆) 环烷基、卤代(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基羰基或卤代(C₁-C₆) 烷基羰基; 和(f94) 氨基羰基,

取代基组B包含: (g1) 氰基; (g2) (C₃-C₆) 环烷基; (g3) (C₁-C₆) 烷氧基; (g4) (C₁-C₆) 烷基硫基; (g5) (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基; (g6) (C₁-C₆) 烷基磺酰基; (g7) 卤代(C₃-C₆) 环烷基; (g8) 卤代(C₁-C₆) 烷氧基; (g9) 卤代(C₁-C₆) 烷基硫基; (g10) 卤代(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基; (g11) 卤代(C₁-C₆) 烷基磺酰基; (g12) (C₁-C₆) 烷氧基羰基; (g13) 氨基羰基; 和(g14) 苯基羰基,

取代基组C包含: (h1) 氰基; (h2) (C₁-C₆) 烷基; (h3) (C₂-C₆) 烯基; (h4) (C₂-C₆) 炔基; (h5) (C₃-C₆) 环烷基; (h6) (C₁-C₆) 烷氧基; (h7) (C₁-C₆) 烷基硫基; (h8) (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基; (h9) (C₁-C₆) 烷基磺酰基; (h10) 卤代(C₁-C₆) 烷基; (h11) 卤代(C₃-C₆) 环烷基; (h12) 卤代(C₁-C₆) 烷氧基; (h13) 卤代(C₁-C₆) 烷基硫基; (h14) 卤代(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基; (h15) 卤代(C₁-C₆) 烷基磺酰基; (h16) 氨基羰基; 和(h17) 苯基,

取代基组D包含: (i1) 卤素原子; (i2) 氰基; (i3) 硝基; (i4) 氨基; (i5) 羟基; (i6) 羧基; (i7) (C₁-C₆) 烷基; (i8) (C₁-C₆) 烷氧基; (i9) (C₃-C₆) 环烷基; (i10) (C₁-C₆) 烷基硫基; (i11) (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基; (i12) (C₁-C₆) 烷基磺酰基; (i13) 卤代(C₁-C₆) 烷基; (i14) 卤代(C₁-C₆) 烷氧基; (i15) 卤代(C₃-C₆) 环烷基; (i16) 卤代(C₁-C₆) 烷基硫基; (i17) 卤代(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基; (i18) 卤代(C₁-C₆) 烷基磺酰基; (i19) (C₁-C₆) 烷氧基羰基; (i20) 苯基(C₁-C₆) 烷氧基羰基; (i21) (C₁-C₆) 烷基氨基羰基; (i22) N-卤代(C₁-C₆) 烷基氨基羰基; (i23) 苯基; (i24) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代(C₁-C₆) 烷基和卤代(C₁-C₆) 烷氧基的1~5个取代基的取代苯基; 和(i25) 相邻的2个取代基一起形成的、任选取代有选自卤素原子、苯基和(C₁-C₆) 烷基的亚甲基二氧基,

其中, R²在与四氢哒嗪环的键合原子的相邻原子上不取代有(C₁-C₆) 烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆) 烷基磺酰基、N-(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、N,N-二(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、和R⁶-(R⁷-N=)O=S基, 式中, R⁶表示(C₁-C₆) 烷基、(C₃-C₆) 环烷基、卤代(C₁-C₆) 烷基或(C₁-C₆) 烷氧基(C₁-C₆) 烷基, R⁷表示氢原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₃-C₆) 环烷基、卤代(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷

基羰基或卤代(C₁-C₆)烷基羰基。

2. 根据权利要求1所述的化合物或其盐类, 其中,

R¹、R³、R⁴、R⁵、Y、m、n、取代基组A、B、C和D与权利要求1中的相同,

R²为 (b5) 苯基; (b6) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代苯基; (b7) 吡啶基; (b8) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代吡啶基; (b9) 哒嗪基; (b10) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代哒嗪基; (b11) 嘧啶基; (b12) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代嘧啶基; (b13) 吡嗪基; (b14) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代吡嗪基; (b15) 三嗪基; (b16) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~2个取代基的取代三嗪基; (b17) 2-氧代吡啶基; (b18) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代2-氧代吡啶基; (b19) 呋喃基; (b20) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代呋喃基; (b21) 噁唑基; (b22) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~2个取代基的取代噁唑基; (b23) 异噁唑基; (b24) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~2个取代基的取代异噁唑基; (b25) 噁二唑基; (b26) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1个取代基的取代噁二唑基; (b27) 噻吩基; (b28) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代噻吩基; (b29) 噻唑基; (b30) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~2个取代基的取代噻唑基; (b31) 异噻唑基; (b32) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~2个取代基的取代异噻唑基; (b33) 噻二唑基; (b34) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1个取代基的取代噻二唑基; (b35) 吡咯基; (b36) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代吡咯基; (b37) 吡唑基; (b38) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代吡唑基; (b39) 咪唑基; (b40) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代咪唑基; (b41) 三唑基; (b42) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~2个取代基的取代三唑基; (b43) 四唑基; (b44) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1个取代基的取代四唑基; (b45) 苯并呋喃基; (b46) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代苯并呋喃基; (b47) 苯并噁唑基; (b48) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代苯并噁唑基; (b49) 苯并异噁唑基; (b50) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代苯并异噁唑基; (b51) 苯并噻吩基; (b52) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代苯并噻吩基; (b53) 苯并噻唑基; (b54) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代苯并噻唑基; (b55) 苯并异噻唑基; (b56) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代苯并异噻唑基; (b57) 吲哚基; (b58) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~6个取代基的取代吲哚基; (b59) 异吲哚基; (b60) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~6个取代基的取代异吲哚基; (b61) 吲唑基; (b62) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代吲唑基; (b63) 苯并咪唑基; (b64) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代苯并咪唑基; (b65) 苯并三唑基; (b66) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代苯并三唑基; (b67) 呋喃并吡啶基; (b68) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代呋喃并吡啶基; (b69) 噻吩并吡啶基; (b70) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代噻吩并吡啶基; (b71) 噻唑并吡啶基; (b72) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代噻唑并吡啶基; (b73) 咪唑并吡啶

基; (b74) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代咪唑并吡啶基; (b75) 吡啶基; (b76) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~6个取代基的取代吡啶基; (b77) 吡咯并吡啶基; (b78) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代吡咯并吡啶基; (b79) 吡咯并嘧啶基; (b80) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代吡咯并嘧啶基; (b81) 噁唑并吡啶基; (b82) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代噁唑并吡啶基; (b83) 异噁唑并吡啶基; (b84) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代异噁唑并吡啶基; (b85) 异噁唑并吡啶基; (b86) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代异噁唑并吡啶基; (b87) 咪唑并嘧啶基; (b88) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代咪唑并嘧啶基; (b89) 吡唑并吡啶基; (b90) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代吡唑并吡啶基; (b91) 吡唑并嘧啶基; (b92) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代吡唑并嘧啶基; (b93) 三唑并吡啶基; (b94) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代三唑并吡啶基; (b95) 三唑并嘧啶基; (b96) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代三唑并嘧啶基; (b97) 喹啉基; (b98) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代喹啉基; (b99) 喹啉基; (b100) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~6个取代基的取代喹啉基; (b101) 萘基; (b102) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~7个取代基的取代萘基; (b103) 异喹啉基; (b104) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~6个取代基的取代异喹啉基; (b105) 噌嗪基; (b106) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代噌嗪基; (b107) 酞嗪基; (b108) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代酞嗪基; (b109) 喹啉基; (b110) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代喹啉基; (b111) 萘啶基; 或 (b112) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代萘啶基。

3. 根据权利要求1或2所述的化合物或其盐类, 其中,

R^1 为 (a1) 氢原子; (a2) (C_1-C_6) 烷基; (a6) 卤代 (C_1-C_6) 烷基; (a9) 在链上具有分别独立地选自氰基、(C_1-C_6) 烷氧基和 (C_3-C_6) 环烷基的1~3个取代基的取代 (C_1-C_6) 烷基; (a11) (C_1-C_6) 烷基羰基; (a12) 卤代 (C_1-C_6) 烷基羰基; (a13) (C_3-C_6) 环烷基羰基; (a22) (C_1-C_6) 烷氧基羰基; (a23) 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基羰基; (a24) (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷氧基羰基; (a35) N- (C_1-C_6) 烷基氨基羰基; (a41) N- (C_3-C_6) 环烷基氨基羰基; (a52) (C_1-C_6) 烷基磺酰基; (a69) N- (C_1-C_6) 烷基氨基硫羰基; (a76) N- (C_3-C_6) 环烷基氨基硫羰基; (a82) 苯基 (C_1-C_6) 烷基; (a84) 噻唑基 (C_1-C_6) 烷基; (a85) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、(C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和 (C_1-C_6) 烷氧基的1~2个取代基的取代噻唑基 (C_1-C_6) 烷基; (a86) 苯基磺酰基; 或 (a87) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、(C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和 (C_1-C_6) 烷氧基的1~5个取代基的取代苯基磺酰基,

R^2 为 (b5) 苯基; (b6) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代苯基; (b7) 吡啶基; (b8) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代吡啶基; (b9) 哒嗪基; (b10) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代哒嗪基; (b11) 嘧啶基; (b12) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代嘧啶基; (b13) 吡嗪基; (b14) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代吡嗪

基; (b21) 噁唑基; (b22) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~2个取代基的取代噁唑基; (b25) 噁二唑基; (b26) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1个取代基的取代噁二唑基; (b27) 噻吩基; (b28) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代噻吩基; (b29) 噻唑基; (b30) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~2个取代基的取代噻唑基; (b31) 异噻唑基; (b32) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~2个取代基的取代异噻唑基; (b33) 噻二唑基; (b34) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1个取代基的取代噻二唑基; (b97) 喹啉基; (b98) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代喹啉基; (b99) 喹啉基; 或 (b100) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~6个取代基的取代喹啉基,

R^3 为 (c1) 氢原子; (c2) (C_1-C_6) 烷基; (c3) (C_3-C_6) 环烷基; (c5) (C_1-C_6) 烷基羰基; 或 (c6) (C_1-C_6) 烷氧基羰基,

R^4 为 (d1) (C_1-C_6) 烷基; (d3) (C_2-C_6) 炔基; (d4) (C_3-C_6) 环烷基; (d5) 卤代 (C_1-C_6) 烷基; (d9) 具有分别独立地选自取代基组B的1~3个取代基的取代 (C_1-C_6) 烷基; (d10) 在环上具有分别独立地选自取代基组C的1~3个取代基的取代 (C_3-C_6) 环烷基; (d17) 苯基; (d18) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~5个取代基的取代苯基; (d19) 吡啶基; (d20) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~4个取代基的取代吡啶基; (d21) 哒嗪基; (d22) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代哒嗪基; (d23) 嘧啶基; (d24) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代嘧啶基; (d25) 吡嗪基; (d26) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代吡嗪基; (d43) 吡唑基; 或 (d44) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代吡唑基,

R^5 为 (e1) (C_1-C_6) 烷基; (e2) (C_2-C_6) 烯基; (e3) (C_2-C_6) 炔基; (e4) (C_3-C_6) 环烷基; (e5) 卤代 (C_1-C_6) 烷基; (e6) 卤代 (C_2-C_6) 烯基; (e9) 在链上具有分别独立地选自氰基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷基羰基、 (C_3-C_6) 环烷基羰基、苯基羰基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基、氨基羰基、卤代 (C_1-C_6) 烷基羰基、 (C_1-C_6) 烷基巯基、三 (C_1-C_6) 烷基甲硅烷基 (C_1-C_6) 烷氧基和三 (C_1-C_6) 烷基甲硅烷基的1~3个取代基的取代 (C_1-C_6) 烷基, 所述三 (C_1-C_6) 烷基甲硅烷基 (C_1-C_6) 烷氧基和所述三 (C_1-C_6) 烷基甲硅烷基各自中 (C_1-C_6) 烷基任选相同或不同; (e11) 苯基 (C_1-C_6) 烷基; (e12) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基、 (C_1-C_6) 烷基巯基、 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基、卤代 (C_1-C_6) 烷基巯基、二苯基氨基、苯氧基和相邻的2个取代基一起形成的亚甲基二氧基的1~5个取代基的取代苯基 (C_1-C_6) 烷基; (e13) 吡啶基 (C_1-C_6) 烷基; (e14) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基和卤代 (C_1-C_6) 烷基巯基的1~4个取代基的取代吡啶基 (C_1-C_6) 烷基; (e15) 噁唑基 (C_1-C_6) 烷基; (e16) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基和卤代 (C_1-C_6) 烷基巯基的1~2个取代基的取代噁唑基 (C_1-C_6) 烷基; (e17) 噁二唑 (C_1-C_6) 烷基; (e18) 在环上具有吡啶基的取代噁二唑 (C_1-C_6) 烷基; (e19) 萘基 (C_1-C_6) 烷基; (e20) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基和卤代 (C_1-C_6) 烷基巯基的1~7个取代基的取代萘基 (C_1-C_6) 烷基; (e21) 喹啉基

(C₁-C₆) 烷基; (e22) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基硫基的1~6个取代基的取代喹啉基 (C₁-C₆) 烷基; (e23) 噻吩基 (C₁-C₆) 烷基; (e24) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基硫基的1~3个取代基的取代噻吩基 (C₁-C₆) 烷基; (e25) 吡唑基 (C₁-C₆) 烷基; (e26) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基硫基的1~3个取代基的取代吡唑基 (C₁-C₆) 烷基; (e27) 噁唑基 (C₁-C₆) 烷基; (e28) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基硫基的1或2个取代基的取代噁唑基 (C₁-C₆) 烷基; (e29) 咪唑基 (C₁-C₆) 烷基; (e30) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基硫基的1~3个取代基的取代咪唑基 (C₁-C₆) 烷基; (e31) 吡啶基; (e32) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基硫基的1~4个取代基的取代吡啶基; (e33) 苯基; (e34) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基硫基的1~5个取代基的取代苯基; (e35) (C₁-C₆) 烷基羰基; 或 (e36) 氢原子,

R³和R⁵任选彼此键合而形成5~6元环,

Y为氧原子、或NR⁶, 式中,R⁶表示氢原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₃-C₆) 环烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基羰基、卤代 (C₁-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、苯基磺酰基或在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基和(C₁-C₆) 烷基的1~5个取代基的苯基磺酰基,

m为0或1,

n为0或1,

取代基组A包含: (f1) 卤素原子; (f2) 氰基; (f6) (C₁-C₆) 烷基; (f9) (C₁-C₆) 烷氧基; (f10) (C₃-C₆) 环烷基; (f11) (C₁-C₆) 烷基硫基; (f14) 卤代 (C₁-C₆) 烷基; (f17) 卤代 (C₁-C₆) 烷氧基; (f22) N,N-二(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基, 该基团中(C₁-C₆) 烷基任选相同或不同; (f59) 四唑基; (f60) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基和卤代 (C₁-C₆) 烷氧基的1个取代基的取代四唑基; 和 (f94) 氨基羰基,

取代基组B包含: (g1) 氰基; (g2) (C₃-C₆) 环烷基; (g3) (C₁-C₆) 烷氧基; 和 (g4) (C₁-C₆) 烷基硫基,

取代基组C包含: (h1) 氰基; (h2) (C₁-C₆) 烷基; 和 (h10) 卤代 (C₁-C₆) 烷基,

取代基组D包含: (i1) 卤素原子; (i2) 氰基; (i7) (C₁-C₆) 烷基; (i8) (C₁-C₆) 烷氧基; (i9) (C₃-C₆) 环烷基; (i10) (C₁-C₆) 烷基硫基; (i13) 卤代 (C₁-C₆) 烷基; (i14) 卤代 (C₁-C₆) 烷氧基; (i15) 卤代 (C₃-C₆) 环烷基; (i19) (C₁-C₆) 烷氧基羰基; 和 (i25) 相邻的2个取代基一起形成的、任选取代有选自卤素原子、苯基和(C₁-C₆) 烷基的亚甲基二氧基。

4. 根据权利要求1~3中任一项所述的化合物或其盐类, 其中,

R¹为 (a1) 氢原子; (a2) (C₁-C₆) 烷基; (a6) 卤代 (C₁-C₆) 烷基; (a9) 在链上具有分别独立地

选自氰基、 (C_1-C_6) 烷氧基和 (C_3-C_6) 环烷基的 1~3 个取代基的取代 (C_1-C_6) 烷基; (a13) (C_3-C_6) 环烷基羰基; (a22) (C_1-C_6) 烷氧基羰基; (a24) (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷氧基羰基; (a35) N- (C_1-C_6) 烷基氨基羰基; (a52) (C_1-C_6) 烷基磺酰基; (a82) 苯基 (C_1-C_6) 烷基; 或 (a85') 在环上具有分别独立地选自卤素原子的 1~2 个取代基的取代噻唑基 (C_1-C_6) 烷基,

R^2 为 (b5) 苯基; (b6) 在环上具有分别独立地选自取代基组 A 的 1~5 个取代基的取代苯基; (b7) 吡啶基; (b8) 在环上具有分别独立地选自取代基组 A 的 1~4 个取代基的取代吡啶基; (b10) 在环上具有分别独立地选自取代基组 A 的 1~3 个取代基的取代哒嗪基; 或 (b12) 在环上具有分别独立地选自取代基组 A 的 1~3 个取代基的取代嘧啶基,

R^3 为 (c1) 氢原子; (c2) (C_1-C_6) 烷基; (c5) (C_1-C_6) 烷基羰基; 或 (c6) (C_1-C_6) 烷氧基羰基,

R^4 为 (d4) (C_3-C_6) 环烷基; (d17) 苯基; (d18) 在环上具有分别独立地选自取代基组 D 的 1~5 个取代基的取代苯基; (d20) 在环上具有分别独立地选自取代基组 D 的 1~4 个取代基的取代吡啶基; 或 (d44) 在环上具有分别独立地选自取代基组 D 的 1~3 个取代基的取代吡唑基,

R^5 为 (e1) (C_1-C_6) 烷基; (e2) (C_2-C_6) 烯基; (e5) 卤代 (C_1-C_6) 烷基; (e9') 在链上具有分别独立地选自氰基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_3-C_6) 环烷基、氨基羰基、 (C_1-C_6) 烷基巯基和三 (C_1-C_6) 烷基甲硅烷基 (C_1-C_6) 烷氧基的 1~3 个取代基的取代 (C_1-C_6) 烷基, 所述三 (C_1-C_6) 烷基甲硅烷基 (C_1-C_6) 烷氧基中 (C_1-C_6) 烷基任选相同或不同; (e11) 苯基 (C_1-C_6) 烷基; (e12') 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基、 (C_1-C_6) 烷基巯基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基、卤代 (C_1-C_6) 烷基巯基和二苯基氨基的 1~5 个取代基的取代苯基 (C_1-C_6) 烷基; (e14') 在环上具有分别独立地选自卤素原子的 1~4 个取代基的取代吡啶基 (C_1-C_6) 烷基; (e16') 在环上具有分别独立地选自卤素原子的 1~2 个取代基的取代噻唑基 (C_1-C_6) 烷基; (e18) 在环上具有吡啶基的取代噁二唑 (C_1-C_6) 烷基; (e19) 萘基 (C_1-C_6) 烷基; (e21) 喹啉基 (C_1-C_6) 烷基; (e23) 噻吩基 (C_1-C_6) 烷基; (e27) 噁唑基 (C_1-C_6) 烷基; (e35) (C_1-C_6) 烷基羰基; 或 (e36) 氢原子,

R^3 和 R^5 任选彼此键合而形成 5~6 元环,

n 和 m 为 0,

取代基组 A 包含: (f1) 卤素原子; (f2) 氰基; (f6) (C_1-C_6) 烷基; (f9) (C_1-C_6) 烷氧基; (f11) (C_1-C_6) 烷基巯基; (f14) 卤代 (C_1-C_6) 烷基; 和 (f94) 氨基羰基,

取代基组 D 包含: (i1) 卤素原子; (i2) 氰基; (i7) (C_1-C_6) 烷基; (i8) (C_1-C_6) 烷氧基; (i10) (C_1-C_6) 烷基巯基; (i14) 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基; 和 (i19) (C_1-C_6) 烷氧基羰基。

5. 一种杀虫剂, 其含有权利要求 1~4 中任一项所述的化合物或其盐类作为有效成分。

6. 一种农艺园艺用杀虫剂, 其含有权利要求 1~4 中任一项所述的化合物或其盐类作为有效成分。

7. 一种杀虫剂的使用方法, 其中,

用权利要求 5 或 6 所述的杀虫剂的有效量对植物或土壤进行处理。

8. 一种权利要求 1~4 中任一项所述的化合物或其盐类的作为杀虫剂的用途。

1-芳基四氢吡嗪-3,5-二酮衍生物或其盐类和含有该化合物的杀虫剂及其使用方法

技术领域

[0001] 本发明涉及1-芳基四氢吡嗪-3,5-二酮衍生物或其盐类和含有该化合物作为有效成分的杀虫剂及其使用方法。

背景技术

[0002] 专利文献1中报道了一种四氢吡嗪-3,5-二酮衍生物可用作杀虫剂。然而,文献中对于本申请发明的具有巯基-氨基甲叉基结构的化合物没有给出公开或暗示。

[0003] 现有技术文献

[0004] 专利文献

[0005] 专利文献1:国际公开第2021/261563号小册子

发明内容

[0006] 发明所解决的技术问题

[0007] 在农业和园艺等的作物生产中,由害虫等引起的损害目前仍然很大,由于对现有药的抗药性害虫的产生等因素,因此期望新型的杀虫剂和杀螨剂的开发。

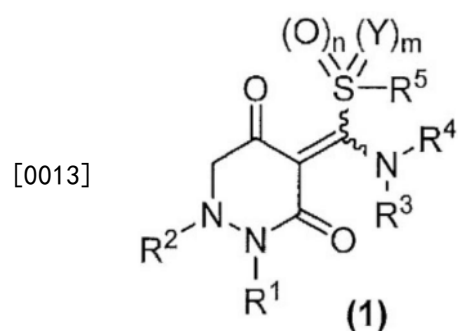
[0008] 解决问题的技术手段

[0009] 本发明人为了开发新型的杀虫剂,特别是农艺园艺用杀虫剂而进行深入研究,结果发现了在1-芳基四氢吡嗪-3,5-二酮骨架上具有巯基-氨基甲叉基结构的本发明的通式(1)表示的化合物或其盐类显示出作为杀虫剂的优异的效果,从而完成了本发明。

[0010] 即本发明涉及:

[0011] [1]一种通式(1)表示的化合物或其盐类,

[0012] [化学式1]



[0014] 式中,

[0015] R¹表示(a1)氢原子;(a2)(C₁-C₆)烷基;(a3)(C₂-C₆)烯基;(a4)(C₂-C₆)炔基;(a5)(C₃-C₆)环烷基;(a6)卤代(C₁-C₆)烷基;(a7)卤代(C₃-C₆)环烷基;(a8)(C₁-C₆)烷氧基;(a9)在链上具有分别独立地选自氰基、(C₁-C₆)烷氧基和(C₃-C₆)环烷基的1~3个取代基的取代(C₁-C₆)烷基;(a10)具有分别独立地选自氰基、(C₁-C₆)烷基和(C₁-C₆)烷氧基的1~3个取代基的取代(C₃-C₆)环烷基;(a11)(C₁-C₆)烷基羰基;(a12)卤代(C₁-C₆)烷基羰基;(a13)(C₃-C₆)环烷

基羰基; (a14) (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基羰基; (a15) (C₁-C₆) 烷基巯基 (C₁-C₆) 烷基羰基; (a16) 苯基羰基; (a17) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基和 (C₁-C₆) 烷氧基的1~5个取代基的取代苯基羰基; (a18) 噻吩基羰基; (a19) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基和 (C₁-C₆) 烷氧基的1~3个取代基的取代噻吩基羰基; (a20) 噻唑基羰基; (a21) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基和 (C₁-C₆) 烷氧基的1~2个取代基的取代噻唑基羰基; (a22) (C₁-C₆) 烷氧基羰基; (a23) 卤代 (C₁-C₆) 烷氧基羰基; (a24) (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷氧基羰基; (a25) (C₁-C₆) 烷基巯基 (C₁-C₆) 烷氧基羰基; (a26) (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷氧基羰基; (a27) (C₂-C₆) 烯氧基羰基; (a28) (C₂-C₆) 炔氧基羰基; (a29) (C₃-C₆) 环烷氧基羰基; (a30) 苯氧基羰基; (a31) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基和 (C₁-C₆) 烷基的1~5个取代基的取代苯氧基羰基; (a32) 苯基 (C₁-C₆) 烷氧基羰基; (a33) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基和 (C₁-C₆) 烷基的1~5个取代基的取代苯基 (C₁-C₆) 烷氧基羰基; (a34) 氨基羰基; (a35) N- (C₁-C₆) 烷基氨基羰基; (a36) N,N-二 (C₁-C₆) 烷基氨基羰基, 该基团中 (C₁-C₆) 烷基任选相同或不同; (a37) N-卤代 (C₁-C₆) 烷基氨基羰基; (a38) N- (C₂-C₆) 烯基氨基羰基; (a39) N- (C₂-C₆) 炔基氨基羰基; (a40) N- (C₁-C₆) 烷基-N- (C₂-C₆) 炔基氨基羰基; (a41) N- (C₃-C₆) 环烷基氨基羰基; (a42) N- (C₁-C₆) 烷氧基氨基羰基; (a43) N- (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基氨基羰基; (a44) N- (C₁-C₆) 烷基巯基 (C₁-C₆) 烷基氨基羰基; (a45) N-苯基 (C₁-C₆) 烷基氨基羰基; (a46) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基和 (C₁-C₆) 烷基的1~5个取代基的N-取代苯基 (C₁-C₆) 烷基氨基羰基; (a47) 吡咯烷基羰基; (a48) N- (C₁-C₆) 烷基胍基羰基; (a49) N,N-二 (C₁-C₆) 烷基胍基羰基, 该基团中 (C₁-C₆) 烷基任选相同或不同; (a50) N-苯基氨基羰基; (a51) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基和 (C₁-C₆) 烷基的1~5个取代基的N-取代苯基氨基羰基; (a52) (C₁-C₆) 烷基磺酰基; (a53) 卤代 (C₁-C₆) 烷基磺酰基; (a54) N- (C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基; (a55) N-卤代 (C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基; (a56) (C₁-C₆) 烷基硫羰基; (a57) 卤代 (C₁-C₆) 烷基硫羰基; (a58) (C₃-C₆) 环烷基硫羰基; (a59) (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基硫羰基; (a60) (C₁-C₆) 烷基硫代 (C₁-C₆) 烷基硫羰基; (a61) (C₁-C₆) 烷氧基硫羰基; (a62) 卤代 (C₁-C₆) 烷氧基硫羰基; (a63) 吡咯烷基硫羰基; (a64) 苯基硫羰基; (a65) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基和 (C₁-C₆) 烷基的1~5个取代基的取代苯基硫羰基; (a66) 苯氧基硫羰基; (a67) 苯基 (C₁-C₆) 烷基硫羰基; (a68) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基和 (C₁-C₆) 烷基的1~5个取代基的取代苯基 (C₁-C₆) 烷基硫羰基; (a69) N- (C₁-C₆) 烷基氨基硫羰基; (a70) N-卤代 (C₁-C₆) 烷基氨基硫羰基; (a71) N,N-二 (C₁-C₆) 烷基氨基硫羰基, 该基团中 (C₁-C₆) 烷基任选相同或不同; (a72) N- (C₂-C₆) 烯基氨基硫羰基; (a73) N- (C₂-C₆) 炔基氨基硫羰基; (a74) N- (C₁-C₆) 烷基-N- (C₂-C₆) 炔基氨基硫羰基; (a75) N- (C₁-C₆) 烷基巯基 (C₁-C₆) 烷基氨基硫羰基; (a76) N- (C₃-C₆) 环烷基氨基硫羰基; (a77) N- (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基氨基硫羰基; (a78) N-苯基氨基硫羰基; (a79) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基和 (C₁-C₆) 烷基的1~5个取代基的取代N-苯基氨基硫羰基; (a80) N-苯基 (C₁-C₆) 烷基氨基硫羰基; (a81) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基和 (C₁-C₆) 烷基的1~5个取代基的取代N-苯基 (C₁-C₆) 烷基氨基硫羰基; (a82) 苯基 (C₁-C₆) 烷基; (a83) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、(C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷基和 (C₁-C₆) 烷氧基的1~5个取代基的取代苯基 (C₁-C₆) 烷基; (a84) 噻唑基 (C₁-C₆) 烷基; (a85) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、(C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆)

烷基和(C₁-C₆)烷氧基的1~2个取代基的取代噻唑基(C₁-C₆)烷基;(a86)苯基磺酰基;或(a87)在环上具有分别独立地选自卤素原子、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基和(C₁-C₆)烷氧基的1~5个取代基的取代苯基磺酰基,

[0016] R²表示(b1)芳基;(b2)在环上具有分别独立地选自取代基组A的1个以上的取代基的取代芳基;(b3)5~10元环杂环基;或(b4)在环上具有分别独立地选自取代基组A的1个以上的取代基的取代5~10元环杂环基,

[0017] R³表示(c1)氢原子;(c2)(C₁-C₆)烷基;(c3)(C₃-C₆)环烷基;(c4)(C₁-C₆)烷氧基;(c5)(C₁-C₆)烷基羰基;或(c6)(C₁-C₆)烷氧基羰基,

[0018] R⁴表示(d1)(C₁-C₆)烷基;(d2)(C₂-C₆)烯基;(d3)(C₂-C₆)炔基;(d4)(C₃-C₆)环烷基;(d5)卤代(C₁-C₆)烷基;(d6)卤代(C₂-C₆)烯基;(d7)卤代(C₂-C₆)炔基;(d8)卤代(C₃-C₆)环烷基;(d9)具有分别独立地选自取代基组B的1~3个取代基的取代(C₁-C₆)烷基;(d10)在环上具有分别独立地选自取代基组C的1~3个取代基的取代(C₃-C₆)环烷基;(d11)N,N-二(C₁-C₆)烷基氨基,该基团中(C₁-C₆)烷基任选相同或不同;(d12)N-(C₁-C₆)烷基-N-苯基氨基;(d13)(C₁-C₆)烷基磺酰基;(d14)N-(C₁-C₆)烷基氨基磺酰基;(d15)哌啶基;(d16)吗啉基;(d17)苯基;(d18)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~5个取代基的取代苯基;(d19)吡啶基;(d20)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~4个取代基的取代吡啶基;(d21)哒嗪基;(d22)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代哒嗪基;(d23)嘧啶基;(d24)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代嘧啶基;(d25)吡嗪基;(d26)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代吡嗪基;(d27)三嗪基;(d28)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~2个取代基的取代三嗪基;(d29)呋喃基;(d30)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代呋喃基;(d31)噁唑基;(d32)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~2个取代基的取代噁唑基;(d33)异噁唑基;(d34)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~2个取代基的取代异噁唑基;(d35)噻吩基;(d36)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代噻吩基;(d37)噻唑基;(d38)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~2个取代基的取代噻唑基;(d39)异噻唑基;(d40)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~2个取代基的取代异噻唑基;(d41)噻二唑基;(d42)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1个取代基的取代噻二唑基;(d43)吡唑基;(d44)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代吡唑基;(d45)三唑基;(d46)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~2个取代基的取代三唑基;(d47)四唑基;(d48)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1个取代基的取代四唑基;(d49)苯并噁唑基;(d50)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~4个取代基的取代苯并噁唑基;(d51)苯并噻唑基;(d52)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~4个取代基的取代苯并噻唑基;(d53)喹啉基;(d54)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~6个取代基的取代喹啉基;(d55)萘基;(d56)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~7个取代基的取代萘基;(d57)四氢萘基;(d58)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~10个取代基的取代四氢萘基;(d59)苯基(C₁-C₆)烷基;(d60)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~5个取代基的取代苯基(C₁-C₆)烷基;(d61)吡啶基(C₁-C₆)烷基;(d62)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~4个取代基的取代吡啶基(C₁-C₆)烷基;(d63)吡嗪基(C₁-C₆)烷基;(d64)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代吡嗪基

(C₁-C₆) 烷基; (d65) 嘧啶基 (C₁-C₆) 烷基; (d66) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代嘧啶基 (C₁-C₆) 烷基; (d67) 呋喃基 (C₁-C₆) 烷基; (d68) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代呋喃基 (C₁-C₆) 烷基; (d69) 噻吩基 (C₁-C₆) 烷基; 或 (d70) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代噻吩基 (C₁-C₆) 烷基;

[0019] R³和R⁴任选彼此键合而形成环,

[0020] R⁵表示 (e1) (C₁-C₆) 烷基; (e2) (C₂-C₆) 烯基; (e3) (C₂-C₆) 炔基; (e4) (C₃-C₆) 环烷基; (e5) 卤代 (C₁-C₆) 烷基; (e6) 卤代 (C₂-C₆) 烯基; (e7) 卤代 (C₂-C₆) 炔基; (e8) 卤代 (C₃-C₆) 环烷基; (e9) 在链上具有分别独立地选自氰基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₃-C₆) 环烷基羰基、苯基羰基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、氨基羰基、卤代 (C₁-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基巯基、三 (C₁-C₆) 烷基甲硅烷基 (C₁-C₆) 烷氧基和三 (C₁-C₆) 烷基甲硅烷基的1~3个取代基的取代 (C₁-C₆) 烷基, 所述三 (C₁-C₆) 烷基甲硅烷基 (C₁-C₆) 烷氧基和所述三 (C₁-C₆) 烷基甲硅烷基各自中 (C₁-C₆) 烷基任选相同或不同; (e10) 具有分别独立地选自氰基、(C₁-C₆) 烷基和 (C₁-C₆) 烷氧基的1~3个取代基的取代 (C₃-C₆) 环烷基; (e11) 苯基 (C₁-C₆) 烷基; (e12) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 烷基巯基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、卤代 (C₁-C₆) 烷基巯基、二苯基氨基、苯氧基和相邻的2个取代基一起形成的亚甲基二氧基的1~5个取代基的取代苯基 (C₁-C₆) 烷基; (e13) 吡啶基 (C₁-C₆) 烷基; (e14) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基巯基的1~4个取代基的取代吡啶基 (C₁-C₆) 烷基; (e15) 噻唑基 (C₁-C₆) 烷基; (e16) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基巯基的1~2个取代基的取代噻唑基 (C₁-C₆) 烷基; (e17) 噁二唑 (C₁-C₆) 烷基; (e18) 在环上具有吡啶基的取代噁二唑 (C₁-C₆) 烷基; (e19) 萘基 (C₁-C₆) 烷基; (e20) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基巯基的1~7个取代基的取代萘基 (C₁-C₆) 烷基; (e21) 喹啉基 (C₁-C₆) 烷基; (e22) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基巯基的1~6个取代基的取代喹啉基 (C₁-C₆) 烷基; (e23) 噻吩基 (C₁-C₆) 烷基; (e24) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基巯基的1~3个取代基的取代噻吩基 (C₁-C₆) 烷基; (e25) 吡唑基 (C₁-C₆) 烷基; (e26) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基巯基的1~3个取代基的取代吡唑基 (C₁-C₆) 烷基; (e27) 噁唑基 (C₁-C₆) 烷基; (e28) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基巯基的1或2个取代基的取代噁唑基 (C₁-C₆) 烷基; (e29) 咪唑基 (C₁-C₆) 烷基; (e30) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基巯基的1~3个取代基的取代咪唑基 (C₁-C₆) 烷基; (e31) 吡啶

基; (e32) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基巯基的1~4个取代基的取代吡啶基; (e33) 苯基; (e34) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基巯基的1~5个取代基的取代苯基; (e35) (C₁-C₆) 烷基羰基; 或 (e36) 氢原子,

[0021] R³和R⁵任选彼此键合而形成5~6元环,

[0022] Y表示氧原子或NR⁶(式中,R⁶表示氢原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₃-C₆) 环烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基羰基、卤代 (C₁-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、苯基磺酰基或在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基和(C₁-C₆) 烷基的1~5个取代基的苯基磺酰基),

[0023] m表示0或1,

[0024] n表示0或1,

[0025] 取代基组A包含: (f1) 卤素原子; (f2) 氰基; (f3) 硝基; (f4) 羟基; (f5) 羧基; (f6) (C₁-C₆) 烷基; (f7) (C₂-C₆) 烯基; (f8) (C₂-C₆) 炔基; (f9) (C₁-C₆) 烷氧基; (f10) (C₃-C₆) 环烷基; (f11) (C₁-C₆) 烷基巯基; (f12) (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基; (f13) (C₁-C₆) 烷基磺酰基; (f14) 卤代 (C₁-C₆) 烷基; (f15) 卤代 (C₂-C₆) 烯基; (f16) 卤代 (C₂-C₆) 炔基; (f17) 卤代 (C₁-C₆) 烷氧基; (f18) 卤代 (C₃-C₆) 环烷基; (f19) 卤代 (C₁-C₆) 烷基巯基; (f20) 卤代 (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基; (f21) 卤代 (C₁-C₆) 烷基磺酰基; (f22) N,N-二(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基, 该基团中(C₁-C₆) 烷基任选相同或不同; (f23) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基和(C₁-C₆) 烷基羰基的1~3个取代基的取代(C₃-C₆) 环烷基; (f24) SF₅基; (f25) (C₁-C₆) 烷氧基(C₁-C₆) 烷基; (f26) (C₁-C₆) 烷氧基(C₁-C₆) 烷氧基; (f27) (C₁-C₆) 烷基羰基氨基; (f28) 卤代 (C₁-C₆) 烷基羰基氨基; (f29) (C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基; (f30) 卤代 (C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基; (f31) (C₁-C₆) 烷氧基羰基; (f32) 相邻的2个取代基一起形成的、任选取代有选自卤素原子、苯基和(C₁-C₆) 烷基的亚甲基二氧基; (f33) (C₁-C₆) 烷基氨基羰基; (f34) N-卤代 (C₁-C₆) 烷基氨基羰基; (f35) 呋喃基; (f36) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基和卤代 (C₁-C₆) 烷氧基的1~3个取代基的取代呋喃基; (f37) 噁唑基; (f38) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基和卤代 (C₁-C₆) 烷氧基的1~2个取代基的取代噁唑基; (f39) 异噁唑基; (f40) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基和卤代 (C₁-C₆) 烷氧基的1~2个取代基的取代异噁唑基; (f41) 噁二唑基; (f42) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₃-C₆) 环烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷基和卤代 (C₁-C₆) 烷氧基的1个取代基的取代噁二唑基; (f43) 噻吩基; (f44) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₃-C₆) 环烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷基和卤代 (C₁-C₆) 烷氧基的1~3个取代基的取代噻吩基; (f45) 噻唑基; (f46) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基和卤代 (C₁-C₆) 烷氧基的1~2个取代基的取代噻唑基; (f47) 异噻唑基; (f48) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基和卤代 (C₁-C₆) 烷氧基的1~2个取代基的取代异噻唑基; (f49) 噻二唑基; (f50) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基和卤代 (C₁-C₆) 烷氧

基的1个取代基的取代噻二唑基；(f51)吡咯基；(f52)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1~3个取代基的取代吡咯基；(f53)吡唑基；(f54)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1~2个取代基的取代吡唑基；(f55)咪唑基；(f56)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1~2个取代基的取代咪唑基；(f57)三唑基；(f58)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1个取代基的取代三唑基；(f59)四唑基；(f60)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1个取代基的取代四唑基；(f61)噁唑啉基；(f62)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1~4个取代基的取代噁唑啉基；(f63)噻唑啉基；(f64)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1~4个取代基的取代噻唑啉基；(f65)异噁唑啉基；(f66)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1~4个取代基的取代异噁唑啉基；(f67)异噻唑啉基；(f68)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1~4个取代基的取代异噻唑啉基；(f69)吡咯烷基；(f70)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1~4个取代基的取代吡咯烷基；(f71)咪唑啉基；(f72)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1~4个取代基的取代咪唑啉基；(f73)苯基；(f74)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、(C₃-C₆)环烷基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1~5个取代基的取代苯基；(f75)吡啶基；(f76)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1~4个取代基的取代吡啶基；(f77)哒嗪基；(f78)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1~3个取代基的取代哒嗪基；(f79)嘧啶基；(f80)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1~3个取代基的取代嘧啶基；(f81)吡嗪基；(f82)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1~3个取代基的取代吡嗪基；(f83)三嗪基；(f84)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1~2个取代基的取代三嗪基；(f85)二氢呋喃基；(f86)二氢吡喃基；(f87)苯氧基；(f88)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1~5个取代基的取代苯氧基；(f89)苯基(C₁-C₆)烷氧基；(f90)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1~5个取代基的取代苯基(C₁-C₆)烷氧基；(f91)苯基(C₁-C₆)烷基硫基；(f92)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基和卤代(C₁-C₆)烷氧基的1~5个取代基的取代苯基(C₁-C₆)烷基硫基；(f93)R⁶-(R⁷-N=)O=S基(式中,R⁶表示(C₁-C₆)烷基、(C₃-

C₆) 环烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷基或 (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基, R⁷ 表示氢原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₃-C₆) 环烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基羰基或卤代 (C₁-C₆) 烷基羰基; 和 (f94) 氨基羰基,

[0026] 取代基组B包含: (g1) 氰基; (g2) (C₃-C₆) 环烷基; (g3) (C₁-C₆) 烷氧基; (g4) (C₁-C₆) 烷基巯基; (g5) (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基; (g6) (C₁-C₆) 烷基磺酰基; (g7) 卤代 (C₃-C₆) 环烷基; (g8) 卤代 (C₁-C₆) 烷氧基; (g9) 卤代 (C₁-C₆) 烷基巯基; (g10) 卤代 (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基; (g11) 卤代 (C₁-C₆) 烷基磺酰基; (g12) (C₁-C₆) 烷氧基羰基; (g13) 氨基羰基; 和 (g14) 苯基羰基,

[0027] 取代基组C包含: (h1) 氰基; (h2) (C₁-C₆) 烷基; (h3) (C₂-C₆) 烯基; (h4) (C₂-C₆) 炔基; (h5) (C₃-C₆) 环烷基; (h6) (C₁-C₆) 烷氧基; (h7) (C₁-C₆) 烷基巯基; (h8) (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基; (h9) (C₁-C₆) 烷基磺酰基; (h10) 卤代 (C₁-C₆) 烷基; (h11) 卤代 (C₃-C₆) 环烷基; (h12) 卤代 (C₁-C₆) 烷氧基; (h13) 卤代 (C₁-C₆) 烷基巯基; (h14) 卤代 (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基; (h15) 卤代 (C₁-C₆) 烷基磺酰基; (h16) 氨基羰基; 和 (h17) 苯基,

[0028] 取代基组D包含: (i1) 卤素原子; (i2) 氰基; (i3) 硝基; (i4) 氨基; (i5) 羟基; (i6) 羧基; (i7) (C₁-C₆) 烷基; (i8) (C₁-C₆) 烷氧基; (i9) (C₃-C₆) 环烷基; (i10) (C₁-C₆) 烷基巯基; (i11) (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基; (i12) (C₁-C₆) 烷基磺酰基; (i13) 卤代 (C₁-C₆) 烷基; (i14) 卤代 (C₁-C₆) 烷氧基; (i15) 卤代 (C₃-C₆) 环烷基; (i16) 卤代 (C₁-C₆) 烷基巯基; (i17) 卤代 (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基; (i18) 卤代 (C₁-C₆) 烷基磺酰基; (i19) (C₁-C₆) 烷氧基羰基; (i20) 苯基 (C₁-C₆) 烷氧基羰基; (i21) (C₁-C₆) 烷基氨基羰基; (i22) N-卤代 (C₁-C₆) 烷基氨基羰基; (i23) 苯基; (i24) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基和卤代 (C₁-C₆) 烷氧基的1~5个取代基的取代苯基; 和 (i25) 相邻的2个取代基一起形成的、任选取代有选自卤素原子、苯基和 (C₁-C₆) 烷基的亚甲基二氧基,

[0029] 其中, R²在与四氢吡嗪环的键合原子的相邻原子上不取代有 (C₁-C₆) 烷基磺酰基、卤代 (C₁-C₆) 烷基磺酰基、N-(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、N,N-二(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基和 R⁶-(R⁷-N=)O=S基(式中, R⁶表示 (C₁-C₆) 烷基、(C₃-C₆) 环烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷基或 (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基, R⁷表示氢原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₃-C₆) 环烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基羰基或卤代 (C₁-C₆) 烷基羰基)。

[0030] [2]根据[1]所述的化合物或其盐类, 其中,

[0031] R¹、R³、R⁴、R⁵、Y、m、n、取代基组A、B、C和D与[1]中的相同,

[0032] R²为 (b5) 苯基; (b6) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代苯基; (b7) 吡啶基; (b8) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代吡啶基; (b9) 哒嗪基; (b10) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代哒嗪基; (b11) 嘧啶基; (b12) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代嘧啶基; (b13) 吡嗪基; (b14) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代吡嗪基; (b15) 三嗪基; (b16) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~2个取代基的取代三嗪基; (b17) 2-氧代吡啶基; (b18) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代2-氧代吡啶基; (b19) 呋喃基; (b20) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代呋喃基; (b21) 噁唑基; (b22) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~2个取代基的取代噁唑基; (b23) 异噁唑基; (b24) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~2个

取代基的取代异噁唑基; (b25) 噁二唑基; (b26) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1个取代基的取代噁二唑基; (b27) 噁吩基; (b28) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代噁吩基; (b29) 噁唑基; (b30) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~2个取代基的取代噁唑基; (b31) 异噁唑基; (b32) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~2个取代基的取代异噁唑基; (b33) 噁二唑基; (b34) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1个取代基的取代噁二唑基; (b35) 吡咯基; (b36) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代吡咯基; (b37) 吡唑基; (b38) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代吡唑基; (b39) 咪唑基; (b40) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代咪唑基; (b41) 三唑基; (b42) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~2个取代基的取代三唑基; (b43) 四唑基; (b44) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1个取代基的取代四唑基; (b45) 苯并呋喃基; (b46) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代苯并呋喃基; (b47) 苯并噁唑基; (b48) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代苯并噁唑基; (b49) 苯并异噁唑基; (b50) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代苯并异噁唑基; (b51) 苯并噁吩基; (b52) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代苯并噁吩基; (b53) 苯并噁唑基; (b54) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代苯并噁唑基; (b55) 苯并异噁唑基; (b56) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代苯并异噁唑基; (b57) 吡啶基; (b58) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~6个取代基的取代吡啶基; (b59) 异吡啶基; (b60) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~6个取代基的取代异吡啶基; (b61) 吡唑基; (b62) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代吡唑基; (b63) 苯并咪唑基; (b64) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代苯并咪唑基; (b65) 苯并三唑基; (b66) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代苯并三唑基; (b67) 呋喃并吡啶基; (b68) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代呋喃并吡啶基; (b69) 噁吩并吡啶基; (b70) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代噁吩并吡啶基; (b71) 噁唑并吡啶基; (b72) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代噁唑并吡啶基; (b73) 咪唑并吡啶基; (b74) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代咪唑并吡啶基; (b75) 吡啶基; (b76) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~6个取代基的取代吡啶基; (b77) 吡咯并吡啶基; (b78) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代吡咯并吡啶基; (b79) 吡咯并噁唑基; (b80) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代吡咯并噁唑基; (b81) 噁唑并吡啶基; (b82) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代噁唑并吡啶基; (b83) 异噁唑并吡啶基; (b84) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代异噁唑并吡啶基; (b85) 异噁唑并吡啶基; (b86) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代异噁唑并吡啶基; (b87) 咪唑并噁唑基; (b88) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代咪唑并噁唑基; (b89) 吡唑并吡啶基; (b90) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代吡唑并吡啶基; (b91) 吡唑并噁唑基; (b92) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代吡唑并噁唑基; (b93) 三唑并吡啶基; (b94) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代三唑并吡啶基; (b95) 三唑并

嘧啶基; (b96) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代三唑并嘧啶基; (b97) 喹喔啉基; (b98) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代喹喔啉基; (b99) 喹啉基; (b100) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~6个取代基的取代喹啉基; (b101) 萘基; (b102) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~7个取代基的取代萘基; (b103) 异喹啉基; (b104) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~6个取代基的取代异喹啉基; (b105) 噌嗪基; (b106) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代噌嗪基; (b107) 酞嗪基; (b108) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代酞嗪基; (b109) 喹唑啉基; (b110) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代喹唑啉基; (b111) 萘啶基; 或 (b112) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代萘啶基。

[0033] [3] 根据[1]或[2]所述的化合物或其盐类, 其中,

[0034] R^1 为 (a1) 氢原子; (a2) (C_1-C_6) 烷基; (a6) 卤代 (C_1-C_6) 烷基; (a9) 在链上具有分别独立地选自氰基、 (C_1-C_6) 烷氧基和 (C_3-C_6) 环烷基的1~3个取代基的取代 (C_1-C_6) 烷基; (a11) (C_1-C_6) 烷基羰基; (a12) 卤代 (C_1-C_6) 烷基羰基; (a13) (C_3-C_6) 环烷基羰基; (a22) (C_1-C_6) 烷氧基羰基; (a23) 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基羰基; (a24) (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷氧基羰基; (a35) N- (C_1-C_6) 烷基氨基羰基; (a41) N- (C_3-C_6) 环烷基氨基羰基; (a52) (C_1-C_6) 烷基磺酰基; (a69) N- (C_1-C_6) 烷基氨基硫羰基; (a76) N- (C_3-C_6) 环烷基氨基硫羰基; (a82) 苯基 (C_1-C_6) 烷基; (a84) 噻唑基 (C_1-C_6) 烷基; (a85) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和 (C_1-C_6) 烷氧基的1~2个取代基的取代噻唑基 (C_1-C_6) 烷基; (a86) 苯基磺酰基; 或 (a87) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷基和 (C_1-C_6) 烷氧基的1~5个取代基的取代苯基磺酰基,

[0035] R^2 为 (b5) 苯基; (b6) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代苯基; (b7) 吡啶基; (b8) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代吡啶基; (b9) 哒嗪基; (b10) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代哒嗪基; (b11) 嘧啶基; (b12) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代嘧啶基; (b13) 吡嗪基; (b14) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代吡嗪基; (b21) 噁唑基; (b22) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~2个取代基的取代噁唑基; (b25) 噁二唑基; (b26) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1个取代基的取代噁二唑基; (b27) 噻吩基; (b28) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代噻吩基; (b29) 噻唑基; (b30) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~2个取代基的取代噻唑基; (b31) 异噻唑基; (b32) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~2个取代基的取代异噻唑基; (b33) 噻二唑基; (b34) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1个取代基的取代噻二唑基; (b97) 喹喔啉基; (b98) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代喹喔啉基; (b99) 喹啉基; 或 (b100) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~6个取代基的取代喹啉基,

[0036] R^3 为 (c1) 氢原子; (c2) (C_1-C_6) 烷基; (c3) (C_3-C_6) 环烷基; (c5) (C_1-C_6) 烷基羰基; 或 (c6) (C_1-C_6) 烷氧基羰基,

[0037] R^4 为 (d1) (C_1-C_6) 烷基; (d3) (C_2-C_6) 炔基; (d4) (C_3-C_6) 环烷基; (d5) 卤代 (C_1-C_6) 烷基; (d9) 具有分别独立地选自取代基组B的1~3个取代基的取代 (C_1-C_6) 烷基; (d10) 在环上

具有分别独立地选自取代基组C的1~3个取代基的取代(C₃-C₆)环烷基；(d17)苯基；(d18)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~5个取代基的取代苯基；(d19)吡啶基；(d20)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~4个取代基的取代吡啶基；(d21)哒嗪基；(d22)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代哒嗪基；(d23)嘧啶基；(d24)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代嘧啶基；(d25)吡嗪基；(d26)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代吡嗪基；(d43)吡唑基；或(d44)在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代吡唑基，

[0038] R⁵为(e1)(C₁-C₆)烷基；(e2)(C₂-C₆)烯基；(e3)(C₂-C₆)炔基；(e4)(C₃-C₆)环烷基；(e5)卤代(C₁-C₆)烷基；(e6)卤代(C₂-C₆)烯基；(e9)在链上具有分别独立地选自氰基、(C₁-C₆)烷氧基、(C₃-C₆)环烷基、(C₁-C₆)烷基羰基、(C₃-C₆)环烷基羰基、苯基羰基、(C₁-C₆)烷氧基羰基、氨基羰基、卤代(C₁-C₆)烷基羰基、(C₁-C₆)烷基巯基、三(C₁-C₆)烷基甲硅烷基(C₁-C₆)烷氧基和三(C₁-C₆)烷基甲硅烷基的1~3个取代基的取代(C₁-C₆)烷基，所述三(C₁-C₆)烷基甲硅烷基(C₁-C₆)烷氧基和所述三(C₁-C₆)烷基甲硅烷基各自中(C₁-C₆)烷基任选相同或不同；(e11)苯基(C₁-C₆)烷基；(e12)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₃-C₆)环烷基、(C₁-C₆)烷氧基羰基、(C₁-C₆)烷基巯基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基巯基、二苯基氨基、苯氧基和相邻的2个取代基一起形成的亚甲基二氧基的1~5个取代基的取代苯基(C₁-C₆)烷基；(e13)吡啶基(C₁-C₆)烷基；(e14)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基和卤代(C₁-C₆)烷基巯基的1~4个取代基的取代吡啶基(C₁-C₆)烷基；(e15)噻唑基(C₁-C₆)烷基；(e16)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基和卤代(C₁-C₆)烷基巯基的1~2个取代基的取代噻唑基(C₁-C₆)烷基；(e17)噁二唑(C₁-C₆)烷基；(e18)在环上具有吡啶基的取代噁二唑(C₁-C₆)烷基；(e19)萘基(C₁-C₆)烷基；(e20)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基和卤代(C₁-C₆)烷基巯基的1~7个取代基的取代萘基(C₁-C₆)烷基；(e21)喹啉基(C₁-C₆)烷基；(e22)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基和卤代(C₁-C₆)烷基巯基的1~6个取代基的取代喹啉基(C₁-C₆)烷基；(e23)噻吩基(C₁-C₆)烷基；(e24)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基和卤代(C₁-C₆)烷基巯基的1~3个取代基的取代噻吩基(C₁-C₆)烷基；(e25)吡唑基(C₁-C₆)烷基；(e26)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基和卤代(C₁-C₆)烷基巯基的1~3个取代基的取代吡唑基(C₁-C₆)烷基；(e27)噁唑基(C₁-C₆)烷基；(e28)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基和卤代(C₁-C₆)烷基巯基的1或2个取代基的取代噁唑基(C₁-C₆)烷基；(e29)咪唑基(C₁-C₆)烷基；(e30)在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基和卤代(C₁-C₆)烷基巯基的1~3个取代基的取代咪唑基

(C₁-C₆) 烷基; (e31) 吡啶基; (e32) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基巯基的1~4个取代基的取代吡啶基; (e33) 苯基; (e34) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和卤代 (C₁-C₆) 烷基巯基的1~5个取代基的取代苯基; (e35) (C₁-C₆) 烷基羰基; 或 (e36) 氢原子,

[0039] R³和R⁵任选彼此键合而形成5~6元环,

[0040] Y为氧原子或NR⁶ (式中,R⁶表示氢原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₃-C₆) 环烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基羰基、卤代 (C₁-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、苯基磺酰基或在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基和(C₁-C₆) 烷基的1~5个取代基的苯基磺酰基),

[0041] m为0或1,

[0042] n为0或1,

[0043] 取代基组A包含: (f1) 卤素原子; (f2) 氰基; (f6) (C₁-C₆) 烷基; (f9) (C₁-C₆) 烷氧基; (f10) (C₃-C₆) 环烷基; (f11) (C₁-C₆) 烷基巯基; (f14) 卤代 (C₁-C₆) 烷基; (f17) 卤代 (C₁-C₆) 烷氧基; (f22) N,N'-二(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基, 该基团中(C₁-C₆) 烷基任选相同或不同; (f59) 四唑基; (f60) 在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷基和卤代 (C₁-C₆) 烷氧基的1个取代基的取代四唑基; 和 (f94) 氨基羰基,

[0044] 取代基组B包含: (g1) 氰基; (g2) (C₃-C₆) 环烷基; (g3) (C₁-C₆) 烷氧基; 和 (g4) (C₁-C₆) 烷基巯基,

[0045] 取代基组C包含: (h1) 氰基; (h2) (C₁-C₆) 烷基; 和 (h10) 卤代 (C₁-C₆) 烷基,

[0046] 取代基组D包含: (i1) 卤素原子; (i2) 氰基; (i7) (C₁-C₆) 烷基; (i8) (C₁-C₆) 烷氧基; (i9) (C₃-C₆) 环烷基; (i10) (C₁-C₆) 烷基巯基; (i13) 卤代 (C₁-C₆) 烷基; (i14) 卤代 (C₁-C₆) 烷氧基; (i15) 卤代 (C₃-C₆) 环烷基; (i19) (C₁-C₆) 烷氧基羰基; 和 (i25) 相邻的2个取代基一起形成的、任选取代有选自卤素原子、苯基和(C₁-C₆) 烷基的亚甲基二氧基。

[0047] [4]根据[1]~[3]中任一项所述的化合物或其盐类, 其中,

[0048] R¹为(a1) 氢原子; (a2) (C₁-C₆) 烷基; (a6) 卤代 (C₁-C₆) 烷基; (a9) 在链上具有分别独立地选自氰基、(C₁-C₆) 烷氧基和(C₃-C₆) 环烷基的1~3个取代基的取代 (C₁-C₆) 烷基; (a13) (C₃-C₆) 环烷基羰基; (a22) (C₁-C₆) 烷氧基羰基; (a24) (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷氧基羰基; (a35) N-(C₁-C₆) 烷基氨基羰基; (a52) (C₁-C₆) 烷基磺酰基; (a82) 苯基 (C₁-C₆) 烷基; 或 (a85') 在环上具有分别独立地选自卤素原子的1~2个取代基的取代噻唑基 (C₁-C₆) 烷基,

[0049] R²为(b5) 苯基; (b6) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~5个取代基的取代苯基; (b7) 吡啶基; (b8) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~4个取代基的取代吡啶基; (b10) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代哒嗪基; 或 (b12) 在环上具有分别独立地选自取代基组A的1~3个取代基的取代嘧啶基,

[0050] R³为(c1) 氢原子; (c2) (C₁-C₆) 烷基; (c5) (C₁-C₆) 烷基羰基; 或 (c6) (C₁-C₆) 烷氧基羰基,

[0051] R⁴为(d4) (C₃-C₆) 环烷基; (d17) 苯基; (d18) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~5个取代基的取代苯基; (d20) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~4个取代基的取代吡啶基; 或 (d44) 在环上具有分别独立地选自取代基组D的1~3个取代基的取代吡唑

基,

[0052] R^5 为(e1) (C_1-C_6) 烷基;(e2) (C_2-C_6) 烯基;(e5)卤代 (C_1-C_6) 烷基;(e9')在链上具有分别独立地选自氰基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_3-C_6) 环烷基、氨基羰基、 (C_1-C_6) 烷基巯基和三 (C_1-C_6) 烷基甲硅烷基 (C_1-C_6) 烷氧基的1~3个取代基的取代 (C_1-C_6) 烷基,所述三 (C_1-C_6) 烷基甲硅烷基 (C_1-C_6) 烷氧基中 (C_1-C_6) 烷基任选相同或不同;(e11)苯基 (C_1-C_6) 烷基;(e12')在环上具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基、 (C_1-C_6) 烷基巯基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基、卤代 (C_1-C_6) 烷基巯基和二苯基氨基的1~5个取代基的取代苯基 (C_1-C_6) 烷基;(e14')在环上具有分别独立地选自卤素原子的1~4个取代基的取代吡啶基 (C_1-C_6) 烷基;(e16')在环上具有分别独立地选自卤素原子的1~2个取代基的取代噻唑基 (C_1-C_6) 烷基;(e18)在环上具有吡啶基的取代噁二唑 (C_1-C_6) 烷基;(e19)萘基 (C_1-C_6) 烷基;(e21)喹啉基 (C_1-C_6) 烷基;(e23)噻吩基 (C_1-C_6) 烷基;(e27)噁唑基 (C_1-C_6) 烷基;(e35) (C_1-C_6) 烷基羰基;或(e36)氢原子,

[0053] R^3 和 R^5 任选彼此键合而形成5~6元环,

[0054] n 和 m 为0,

[0055] 取代基组A包含:(f1)卤素原子;(f2)氰基;(f6) (C_1-C_6) 烷基;(f9) (C_1-C_6) 烷氧基;(f11) (C_1-C_6) 烷基巯基;(f14)卤代 (C_1-C_6) 烷基;和(f94)氨基羰基,

[0056] 取代基组D包含:(i1)卤素原子;(i2)氰基;(i7) (C_1-C_6) 烷基;(i8) (C_1-C_6) 烷氧基;(i10) (C_1-C_6) 烷基巯基;(i14)卤代 (C_1-C_6) 烷氧基;和(i19) (C_1-C_6) 烷氧基羰基。

[0057] [5]一种杀虫剂,其含有[1]~[4]中任一项所述的化合物或其盐类作为有效成分。

[0058] [6]一种农艺园艺用杀虫剂,其含有[1]~[4]中任一项所述的化合物或其盐类作为有效成分。

[0059] [7]一种杀虫剂的使用方法,其中,

[0060] 用[5]或[6]所述的杀虫剂的有效量对植物或土壤进行处理。

[0061] [8]一种[1]~[4]中任一项所述的化合物或其盐类的作为杀虫剂的用途。

[0062] 发明的效果

[0063] 本发明的化合物或其盐类作为杀虫剂具有优异的效果。此外,不仅对农艺园艺领域的害虫,对寄生于狗、猫等宠物或牛、羊等家畜的害虫也有效果。

具体实施方式

[0064] 在本发明化合物的通式(1)的定义中,“卤代”意指“卤素原子”,表示氯原子、溴原子、碘原子或氟原子。

[0065] “ (C_1-C_6) 烷基”表示例如甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、正戊基、异戊基、叔戊基、新戊基、2,3-二甲基丙基、1-乙基丙基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、正己基、异己基、2-己基、3-己基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、1,1,2-三甲基丙基、3,3-二甲基丁基等直链或支链状的碳原子数1~6的烷基。

[0066] “ (C_2-C_6) 烯基”表示例如乙烯基、烯丙基、异丙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、戊烯基、1-己烯基、3,3-二甲基-1-丁烯基等直链或支链状的碳原子数2~6的烯基,“ (C_2-C_6) 炔基”表示例如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔

基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、3-甲基-1-丙炔基、2-甲基-3-丙炔基、戊炔基、1-己炔基、3-甲基-1-丁炔基、3,3-二甲基-1-丁炔基等直链或支链状的碳原子数2~6的炔基。

[0067] “(C₃-C₆) 环烷基”表示例如环丙基、环丁基、环戊基、环己基等碳原子数3~6的环状的烷基,“(C₁-C₆) 烷氧基”表示例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、正戊氧基、异戊氧基、叔戊氧基、新戊氧基、2,3-二甲基丙氧基、1-乙基丙氧基、1-甲基丁氧基、正己氧基、异己氧基、1,1,2-三甲基丙氧基等直链或支链状的碳原子数1~6的烷氧基。

[0068] “(C₁-C₆) 烷基巯基”表示例如甲基巯基、乙基巯基、正丙基巯基、异丙基巯基、正丁基巯基、仲丁基巯基、叔丁基巯基、正戊基巯基、异戊基巯基、叔戊基巯基、新戊基巯基、2,3-二甲基丙基巯基、1-乙基丙基巯基、1-甲基丁基巯基、正己基巯基、异己基巯基、1,1,2-三甲基丙基巯基等直链或支链状的碳原子数1~6的烷基巯基。

[0069] “(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基”表示例如甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正丙基亚磺酰基、异丙基亚磺酰基、正丁基亚磺酰基、仲丁基亚磺酰基、叔丁基亚磺酰基、正戊基亚磺酰基、异戊基亚磺酰基、叔戊基亚磺酰基、新戊基亚磺酰基、2,3-二甲基丙基亚磺酰基、1-乙基丙基亚磺酰基、1-甲基丁基亚磺酰基、正己基亚磺酰基、异己基亚磺酰基、1,1,2-三甲基丙基亚磺酰基等直链或支链状的碳原子数1~6的烷基亚磺酰基。

[0070] “(C₁-C₆) 烷基磺酰基”表示例如甲基磺酰基、乙基磺酰基、正丙基磺酰基、异丙基磺酰基、正丁基磺酰基、仲丁基磺酰基、叔丁基磺酰基、正戊基磺酰基、异戊基磺酰基、叔戊基磺酰基、新戊基磺酰基、2,3-二甲基丙基磺酰基、1-乙基丙基磺酰基、1-甲基丁基磺酰基、正己基磺酰基、异己基磺酰基、1,1,2-三甲基丙基磺酰基等直链或支链状的碳原子数1~6的烷基磺酰基。

[0071] “(C₁-C₆) 烷基羰基”表示例如乙酰基、丙酰基、丁酰基、2-甲基丙酰基、戊酰基(pentanoyl)、2-甲基丁酰基、3-甲基丁酰基、三甲基乙酰基、己酰基等具有所述(C₁-C₆) 烷基的烷基羰基等、碳原子数2~7的烷基羰基。

[0072] “(C₃-C₆) 环烷基羰基”表示例如环丙基羰基、环丁基羰基、环戊基羰基、环己基羰基等具有所述(C₃-C₆) 环烷基的环烷基羰基等、碳原子数4~7的环烷基羰基。

[0073] “(C₁-C₆) 烷基羰基氨基”表示例如乙酰基氨基、丙酰基氨基、丁酰基氨基、2-甲基丙酰基氨基、戊酰基氨基、2-甲基丁酰基氨基、3-甲基丁酰基氨基、新戊酰基氨基、己酰基氨基等具有所述(C₁-C₆) 烷基的烷基羰基氨基等、碳原子数2~7的烷基羰基氨基。

[0074] “(C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基”表示例如甲基磺酰基氨基、乙基磺酰基氨基、正丙基磺酰基氨基、异丙基磺酰基氨基、正丁基磺酰基氨基、仲丁基磺酰基氨基、叔丁基磺酰基氨基、正戊基磺酰基氨基、异戊基磺酰基氨基、叔戊基磺酰基氨基、新戊基磺酰基氨基、2,3-二甲基丙基磺酰基氨基、1-乙基丙基磺酰基氨基、1-甲基丁基磺酰基氨基、正己基磺酰基氨基、异己基磺酰基氨基、1,1,2-三甲基丙基磺酰基氨基等直链或支链状的碳原子数1~6的烷基磺酰基氨基。

[0075] “N-(C₁-C₆) 烷基氨基羰基”表示例如N-甲基氨基羰基、N-乙基氨基羰基、N-正丙基氨基羰基、N-异丙基氨基羰基、N-正丁基氨基羰基、N-异丁基氨基羰基、N-仲丁基氨基羰基、N-叔丁基氨基羰基、N-正戊基氨基羰基、N-异戊基氨基羰基、N-叔戊基氨基羰基、N-新戊基氨基羰基、N-正己基氨基羰基、N-异己基氨基羰基等具有直链或支链状的碳原子数1~6的

烷基的碳原子数2~7的烷基氨基羰基。

[0076] “N,N-二(C₁-C₆) 烷基氨基羰基”表示例如N,N-二甲基氨基羰基、N,N-二乙基氨基羰基、N,N-二正丙基氨基羰基、N,N-二异丙基氨基羰基、N,N-二正丁基氨基羰基、N,N-二仲丁基氨基羰基、N,N-二叔丁基氨基羰基、N-甲基-N-乙基氨基羰基、N-甲基-N-正丙基氨基羰基、N-甲基-N-异丙基氨基羰基、N-甲基-N-正丁基氨基羰基、N-甲基-N-仲丁基氨基羰基、N-甲基-N-叔丁基氨基羰基、N-甲基-N-正戊基氨基羰基、N-甲基-N-异戊基氨基羰基、N-甲基-N-叔戊基氨基羰基、N-甲基-N-新戊基氨基羰基、N-甲基-N-(2,3-二甲基丙基)氨基羰基、N-甲基-N-(1-乙基丙基)氨基羰基、N-甲基-N-(1-甲基丁基)氨基羰基、N-甲基-N-正己基氨基羰基、N-甲基-N-异己基氨基羰基、N-甲基-N-(1,1,2-三甲基丙基)氨基羰基等直链或支链状的具有碳原子数1~6的烷基的碳原子数3~13的二烷基氨基羰基。

[0077] “(C₁-C₆) 烷氧基羰基”表示例如甲氧基羰基、乙氧基羰基、正丙氧基羰基、异丙氧基羰基、正丁氧基羰基、异丁氧基羰基、仲丁氧基羰基、叔丁氧基羰基、戊氧基羰基等具有所述(C₁-C₆) 烷氧基的烷氧基羰基等、碳原子数2~7的烷氧基羰基。

[0078] “N-(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基(N-(C₁-C₆) alkylaminosulfonyl group)”表示例如N-甲基氨基磺酰基、N-乙基氨基磺酰基、N-正丙基氨基磺酰基、N-异丙基氨基磺酰基、N-正丁基氨基磺酰基、N-仲丁基氨基磺酰基、N-叔丁基氨基磺酰基、N-正戊基氨基磺酰基、N-异戊基氨基磺酰基、N-叔戊基氨基磺酰基、N-新戊基氨基磺酰基、N-(2,3-二甲基丙基)氨基磺酰基、N-(1-乙基丙基)氨基磺酰基、N-(1-甲基丁基)氨基磺酰基、N-正己基氨基磺酰基、N-异己基氨基磺酰基、N-(1,1,2-三甲基丙基)氨基磺酰基等直链或支链状的碳原子数1~6的烷基氨基磺酰基。

[0079] “N,N-二(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基”表示例如N,N-二甲基氨基磺酰基、N,N-二乙基氨基磺酰基、N,N-二正丙基氨基磺酰基、N,N-二异丙基氨基磺酰基、N,N-二正丁基氨基磺酰基、N,N-二仲丁基氨基磺酰基、N,N-二叔丁基氨基磺酰基、N-甲基-N-乙基氨基磺酰基、N-甲基-N-正丙基氨基磺酰基、N-甲基-N-异丙基氨基磺酰基、N-甲基-N-正丁基氨基磺酰基、N-甲基-N-仲丁基氨基磺酰基、N-甲基-N-叔丁基氨基磺酰基、N-甲基-N-正戊基氨基磺酰基、N-甲基-N-异戊基氨基磺酰基、N-甲基-N-叔戊基氨基磺酰基、N-甲基-N-新戊基氨基磺酰基、N-甲基-N-(2,3-二甲基丙基)氨基磺酰基、N-甲基-N-(1-乙基丙基)氨基磺酰基、N-甲基-N-(1-甲基丁基)氨基磺酰基、N-甲基-N-正己基氨基磺酰基、N-甲基-N-异己基氨基磺酰基、N-甲基-N-(1,1,2-三甲基丙基)氨基磺酰基等直链或支链状的具有碳原子数1~6的烷基的碳原子数2~12的二烷基氨基磺酰基。

[0080] 在所述“(C₁-C₆) 烷基”、“(C₂-C₆) 烯基”、“(C₂-C₆) 炔基”、“(C₁-C₆) 烷氧基”、“(C₁-C₆) 烷基巯基”、“(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基”、“(C₁-C₆) 烷基磺酰基”、“(C₃-C₆) 环烷基”、“(C₁-C₆) 烷基羰基氨基”、“(C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基”、“N-(C₁-C₆) 烷基氨基羰基”等在任选取代的位置上任选取代有1或2个以上的卤素原子,在取代的卤素原子为2个以上的情况下,卤素原子任选相同或不同。

[0081] 分别表示为“卤代(C₁-C₆) 烷基”、“卤代(C₂-C₆) 烯基”、“卤代(C₂-C₆) 炔基”、“卤代(C₁-C₆) 烷氧基”、“卤代(C₁-C₆) 烷基巯基”、“卤代(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基”、“卤代(C₁-C₆) 烷基磺酰基”、“卤代(C₃-C₆) 环烷基”、“卤代(C₁-C₆) 烷基羰基氨基”、“卤代(C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基”、“N-卤代(C₁-C₆) 烷基氨基羰基”等。

[0082] “(C₁-C₆)”、“(C₂-C₆)”、“(C₃-C₆)”等表述是指各种取代基的碳原子数的范围。此外,对于所述取代基连接的基团,可以采用上述定义,例如在“(C₁-C₆) 烷氧基(C₁-C₆) 烷基”的情况下,直链或支链状的碳原子数1~6的烷氧基与直链或支链状的碳原子数1~6的烷基键合。

[0083] “芳基”表示例如苯基、1-萘基、2-萘基等碳原子数6~10的芳香族烃基。

[0084] 作为“5~10元环杂环基”,可举出:作为环构成原子除碳原子以外含有1~4个选自氧原子、硫原子和氮原子中的杂原子的5或者6元的单环式芳香族杂环基、该单环式芳香族杂环与苯环或者单环式芳香族环缩合而成的芳香族缩合杂环基、4~6元的单环式非芳香族杂环基或该单环式非芳香族杂环与苯环或者单环式芳香族环缩合而成的非芳香族缩合杂环基等。所述5~10元环杂环基的环构成原子可被氧代基氧化。

[0085] “单环式芳香族杂环基”表示例如呋喃基、噻吩基、吡啶基、2-氧代吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、吡咯基、咪唑基、吡唑基、噻唑基、异噻唑基、噁唑基、异噁唑基、噁二唑基(例如1,3,4-噁二唑基、1,2,4-噁二唑基)、噻二唑基(例如1,3,4-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基)、三唑基(例如1,2,4-三唑基)、四唑基、三嗪基(例如1,3,5-三嗪基、1,2,4-三嗪基)等,“芳香族缩合杂环基”表示例如喹啉基、异喹啉基、喹唑啉基、喹喔啉基、噌嗪基、酞嗪基、萘啶基、苯并呋喃基、苯并噻吩基、苯并噁唑基、苯并异噁唑基、苯并噻唑基、苯并异噻唑基、苯并咪唑基、苯并三唑基、吲哚基、异吲哚基、吲唑基、呋喃并吡啶基、噻吩并吡啶基、吡咯并吡啶基(例如吡咯并[1,2-a]吡啶基、吡咯并[2,3-b]吡啶基)、噁唑并吡啶基(例如噁唑并[3,2-a]吡啶基、噁唑并[5,4-b]吡啶基、噁唑并[4,5-b]吡啶基)、异噁唑并吡啶基(例如异噁唑并[2,3-a]吡啶基、异噁唑并[4,5-b]吡啶基、异噁唑并[5,4-b]吡啶基)、噻唑并吡啶基(例如噻唑并[3,2-a]吡啶基、噻唑并[5,4-b]吡啶基、噻唑并[4,5-b]吡啶基)、异噻唑并吡啶基(例如异噻唑并[2,3-a]吡啶基、异噻唑并[4,5-b]吡啶基、异噻唑并[5,4-b]吡啶基)、咪唑并吡啶基(例如咪唑并[1,2-a]吡啶基、咪唑并[4,5-b]吡啶基)、吡唑并吡啶基(例如吡唑并[1,5-a]吡啶基、吡唑并[3,4-a]吡啶基、吡唑并[4,3-a]吡啶基)、吲哚嗪基、三唑并吡啶基(例如[1,2,4]三唑并[1,5-a]吡啶基、三唑并嘧啶基、吡咯并嘧啶基、吡咯并吡嗪基、咪唑并嘧啶基、咪唑吡嗪基、吡唑并嘧啶基、吡唑并噻吩基、吡唑并三嗪基等。

[0086] “单环式非芳香族杂环基”表示例如氧杂环丁基、硫杂环丁基、氮杂啉基、吡咯烷基、吡咯烷基-2-酮基、哌啶基、吗啉基、硫吗啉基、哌嗪基、六亚甲基亚氨基、噁唑烷基、噻唑烷基、咪唑烷基、噁唑啉基、噻唑啉基、异噁唑啉基、咪唑啉基、二氧杂环戊烯基(dioxolyl)、二氧杂环戊烷基(dioxolanyl)基、二氢噁二唑基、2-氧代-四氢吡咯-1-基、2-氧代吡啶-4-基、2,4-二氧代嘧啶-5-基、2-氧代-1,3-噁唑烷-5-基、5-氧代-1,2,4-噁二唑啉-3-基、1,3-二氧杂环戊烷-2-基、1,3-二氧杂环己烷-2-基、1,3-二氧杂环庚烷-2-基、吡喃基、四氢吡喃基、噻喃基、四氢噻喃基、1-氧化物四氢噻喃基、1,1-二氧化物四氢噻喃基、四氢呋喃基、二氧杂环己烷基、吡唑烷基、吡唑啉基、四氢嘧啶基、二氢三唑基、四氢三唑基等,“非芳香族缩合杂环基”表示例如二氢吲哚基、二氢异吲哚基、二氢苯并呋喃基、二氢苯并二噁英(Dihydrobenzodioxinyl)基、二氢苯并二氧杂环庚烯基(dihydrobenzodioxepinyl)基、四氢苯并呋喃基、色烯基、二氢喹啉基、四氢喹啉基、二氢异喹啉基、四氢异喹啉基、二氢酞嗪基等。

[0087] R³和R⁴任选彼此键合而形成环。该“环”为从R³除去任意的氢原子而得到的基团与

从 R^4 除去任意的氢原子而得到的基团键合而形成的环。例如,在 R^3 为乙基, R^4 为正丙基,从 R^3 的乙基除去末端的氢原子而得到的基团与从 R^4 的正丙基除去末端的氢原子而得到的基团进行了键合的情况下,形成哌啶。作为所述“环”,可举出氮丙啶、氮杂环丁烷、四氢吡咯、哌啶、高哌啶(homopiperidine)、哌嗪、高哌嗪(homopiperazine)、吗啉、高吗啉(homomorpholine)等3~7元的含氮杂环。所述含氮杂环可以与苯环进行缩合。所述含氮杂环和苯环任选被选自卤素原子、 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷基等中的1~6个取代基取代。

[0088] R^3 和 R^5 任选彼此键合而形成5~6元环。该“5~6元环”为从 R^3 除去任意的氢原子而得到的基团与从 R^5 除去任意的氢原子而得到的基团键合而形成的环。例如,在 R^3 为乙酰基, R^5 为甲基,从 R^3 的乙酰基除去氢原子而得到的基团与从 R^5 的甲基除去氢原子而得到的基团进行了键合的情况下,形成1,3-噻唑烷-4-酮。在 R^3 和 R^5 的一者为氢原子的情况下,另一者可以与 R^3 键合的氮原子或 R^5 键合的硫原子直接键合而形成5~6元环。作为该“5~6元环”,可举出1,3-噻唑烷、六氢-1,3-噻嗪、1,3-噻唑烷-4-酮、1,3-噻唑烷-5-酮、六氢-1,3-噻嗪-4-酮、六氢-1,3-噻嗪-6-酮等。

[0089] 作为由本发明的通式(1)表示的化合物的盐类,例如可举出盐酸盐、硫酸盐、硝酸盐、磷酸盐等无机酸盐类、乙酸盐、富马酸盐、马来酸盐、草酸盐、甲磺酸盐、苯磺酸盐、对甲苯磺酸盐等有机酸盐类、钠离子、钾离子、钙离子、铯离子、镁离子、铵离子、三甲基铵等与无机或有机的碱形成的盐类。

[0090] 就由本发明的通式(1)表示的化合物及其盐类而言,存在其结构式中具有一个或多个不对称中心的情况,也存在2种以上的光学异构体和非对映异构体的情况,本发明全部包含各个光学异构体和以任意的比例包含它们的混合物。此外,就由本发明的通式(1)表示的化合物及其盐类而言,存在其结构式中存在源自碳-碳双键或碳-氮双键的2种以上的几何异构体的情况,本发明全部包含各个几何异构体和以任意的比例包含它们的混合物。此外,由本发明的通式(1)表示的化合物及其盐类中,存在有多个互变异构体的情况,本发明全部包含各个互变异构体和以任意的比例包含它们的混合物。

[0091] 本发明的通式(1)表示的化合物中,在下文中表示优选的方式。

[0092] 通式(1)中, R^1 优选为所述的(a1)、(a2)、(a6)、(a9)、(a11)、(a12)、(a13)、(a22)、(a23)、(a24)、(a35)、(a41)、(a52)、(a69)、(a76)、(a82)、(a84)、(a85)、(a86)或(a87)的基团,

[0093] 更优选为所述的(a1)、(a2)、(a6)、(a9)、(a13)、(a22)、(a24)、(a35)、(a52)、(a82)或(a85')的基团。

[0094] 通式(1)中, R^2 优选为所述的(b5)、(b6)、(b7)、(b8)、(b9)、(b10)、(b11)、(b12)、(b13)、(b14)、(b15)、(b16)、(b17)、(b18)、(b19)、(b20)、(b21)、(b22)、(b23)、(b24)、(b25)、(b26)、(b27)、(b28)、(b29)、(b30)、(b31)、(b32)、(b33)、(b34)、(b35)、(b36)、(b37)、(b38)、(b39)、(b40)、(b41)、(b42)、(b43)、(b44)、(b45)、(b46)、(b47)、(b48)、(b49)、(b50)、(b51)、(b52)、(b53)、(b54)、(b55)、(b56)、(b57)、(b58)、(b59)、(b60)、(b61)、(b62)、(b63)、(b64)、(b65)、(b66)、(b67)、(b68)、(b69)、(b70)、(b71)、(b72)、(b73)、(b74)、(b75)、(b76)、(b77)、(b78)、(b79)、(b80)、(b81)、(b82)、(b83)、(b84)、(b85)、(b86)、(b87)、(b88)、(b89)、(b90)、(b91)、(b92)、(b93)、(b94)、(b95)、(b96)、(b97)、(b98)、(b99)、(b100)、(b101)、(b102)、(b103)、(b104)、(b105)、(b106)、(b107)、

的化合物反应,从而制造本发明的通式(1-1)表示的化合物。

[0117] 作为本反应中可使用的碱,例如可举出氢氧化钠、氢氧化钾等碱金属原子的氢氧化物、氢化钠、氢化钾等碱金属的氢化物、乙醇钠、叔丁醇钾等醇的碱金属盐、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠等碳酸盐类等无机碱、三乙胺、吡啶、N,N-二甲基-4-氨基吡啶、DBU等有机碱等,其使用量相对于通式(2)表示的化合物,通常在1倍摩尔~10倍摩尔的范围内使用。

[0118] 作为本反应中可使用的活泼溶剂,只要不明显阻碍本反应的进行即可,例如可举出戊烷、己烷、环己烷等链状或环状饱和烃类、苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等卤代烃类、氯苯、二氯苯等卤化芳香族烃类、二乙醚、甲基叔丁基醚、二噁烷、四氢呋喃等链状或环状醚类等不活泼溶剂、乙腈、丙腈等腈类、乙酸甲酯等酯类、丙酮、甲基乙基酮等酮类、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮等非质子性极性溶剂、甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、2-丙醇等醇类等,这些不活泼溶剂可以单独使用或混合2种以上使用。就其使用量而言,相对于通式(2)表示的化合物1摩尔,通常适宜选自0.1~100L的范围内即可。

[0119] 本反应为等摩尔反应,因此等摩尔使用各化合物即可,也可以过量使用任一化合物。本反应中的反应温度通常从0℃出发在使用的溶剂的沸点的范围内适宜选择即可,反应时间根据反应规模、反应温度等变化,并不恒定,通常从数分钟~48小时的范围内适宜选择即可。反应结束后,从包含目标产物的反应体系中通过常规方法来分离目标产物即可,可以根据需要用重结晶、柱层析等进行纯化来制造目标产物。

[0120] 工序[b]的制造方法

[0121] 可通过使通式(1-1)表示的化合物在酸和不活泼溶剂的存在下或非存在下,进行水解,而制造通式(1-2)表示的化合物。

[0122] 作为本反应中可使用的酸,例如可举出盐酸、硫酸、硝酸等无机酸、甲酸、乙酸、丙酸、三氟乙酸、苯甲酸等有机酸、甲磺酸、三氟甲磺酸、对甲苯磺酸等磺酸、磷酸等,其使用量相对于通式(1-1)表示的化合物在0.01倍摩尔~10倍摩尔的范围适宜选择即可,该酸也可以用作溶剂。

[0123] 作为本反应中可使用的不活泼溶剂,只要不明显阻碍本反应的进行即可,例如可举出苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等卤代烃类、氯苯、二氯苯等卤化芳香族烃类、二乙醚、甲基叔丁基醚、二噁烷、四氢呋喃等链状或环状醚类、乙酸乙酯等酯类、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等酰胺类、丙酮、甲基乙基酮等酮类、二甲基亚砜、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮等极性溶剂等不活泼溶剂,这些不活泼溶剂可以单独使用或混合2种以上使用。不活泼溶剂的使用量为使反应试剂溶解的量,就没有特别限定,相对于通式(1-1)表示的化合物1摩尔从0.5L~100L的范围适宜选择即可。此外,在将所述酸用作溶剂的情况下也可以不使用溶剂。

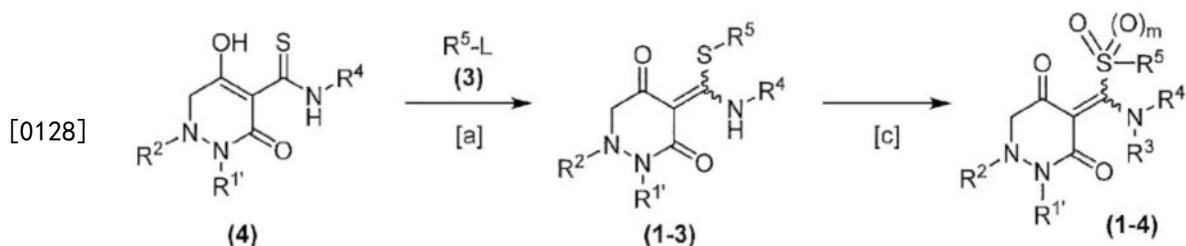
[0124] 反应温度可以在从室温至使用的酸或不活泼溶剂的沸点区域中进行,反应时间根据反应规模、反应温度等变化,并不恒定,通常从数分钟~48小时的范围内适宜选择即可。反应结束后,从包含目标产物的反应体系中通过常规方法来分离目标产物即可,可以根据需要用重结晶、柱层析等进行纯化来制造目标产物。

[0125] 制造方法2

[0126] 本发明的通式(1-3)和(1-4)表示的化合物可通过从通式(4)表示的化合物出发,

通过下述工序[a]和[c]而制造。需要说明的是,[a]的反应条件与所述相同。

[0127] [化学式3]



[0129] 式中, R^2 、 R^4 、 R^5 和 m 与所述相同。 $R^{1'}$ 表示 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、在链上具有分别独立地选自氰基、 (C_1-C_6) 烷氧基和 (C_3-C_6) 环烷基的1~3个取代基的取代 (C_1-C_6) 烷基、具有分别独立地选自氰基、 (C_1-C_6) 烷基和 (C_1-C_6) 烷氧基的1~3个取代基的取代 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷基羰基、卤代 (C_1-C_6) 烷基羰基、 (C_3-C_6) 环烷基羰基、 (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷基羰基、 (C_1-C_6) 烷基硫基 (C_1-C_6) 烷基羰基、苯基羰基、具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基和 (C_1-C_6) 烷氧基的1~3个取代基的取代苯基羰基、噻吩基羰基、具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基和 (C_1-C_6) 烷氧基的1~3个取代基的取代噻吩基羰基、噻唑基羰基、具有分别独立地选自卤素原子、氰基、 (C_1-C_6) 烷基和 (C_1-C_6) 烷氧基的1~3个取代基的取代噻唑基羰基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基羰基、 (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷氧基羰基、 (C_1-C_6) 烷基硫基 (C_1-C_6) 烷氧基羰基、 (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷氧基羰基、 (C_2-C_6) 烯基羰基、 (C_2-C_6) 炔基羰基、 (C_3-C_6) 环烷基羰基、苯氧基羰基、具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基和 (C_1-C_6) 烷基的1~3个取代基的取代苯氧基羰基、苯基 (C_1-C_6) 烷氧基羰基、具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基和 (C_1-C_6) 烷基的1~3个取代基的取代苯基 (C_1-C_6) 烷氧基羰基、氨基羰基、N- (C_1-C_6) 烷基氨基羰基、N,N-二 (C_1-C_6) 烷基氨基羰基(该基团中 (C_1-C_6) 烷基任选相同或不同)、N-卤代 (C_1-C_6) 烷基氨基羰基、N- (C_2-C_6) 烯基氨基羰基、N- (C_2-C_6) 炔基氨基羰基、N- (C_1-C_6) 烷基-N- (C_2-C_6) 炔基氨基羰基、N- (C_3-C_6) 环烷基氨基羰基、N- (C_1-C_6) 烷氧基氨基羰基、N- (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷基氨基羰基、N- (C_1-C_6) 烷基硫基 (C_1-C_6) 烷基氨基羰基、N-苯基 (C_1-C_6) 烷基氨基羰基、具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基和 (C_1-C_6) 烷基的1~3个取代基的N-取代苯基 (C_1-C_6) 烷基氨基羰基、吡咯烷基羰基、N- (C_1-C_6) 烷基胍基羰基、N,N-二 (C_1-C_6) 烷基胍基羰基(该基团中 (C_1-C_6) 烷基任选相同或不同)、N-苯基氨基羰基、具有分别独立地选自卤素原子、氰基和 (C_1-C_6) 烷基的1~3个取代基的N-取代苯基氨基羰基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基、卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基、N- (C_1-C_6) 烷基氨基磺酰基、N-卤代 (C_1-C_6) 烷基氨基磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基硫羰基、卤代 (C_1-C_6) 烷基硫羰基、 (C_3-C_6) 环烷基硫羰基、 (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷基硫羰基、 (C_1-C_6) 烷基硫代 (C_1-C_6) 烷基硫羰基、 (C_1-C_6) 烷氧基硫羰基、卤代 (C_1-C_6) 烷氧基硫羰基、吡咯烷基硫羰基、苯基硫羰基、具有分别独立地选自卤素原子、氰基和 (C_1-C_6) 烷基的1~3个取代基的取代苯基硫羰基、苯氧基硫羰基、苯基 (C_1-C_6) 烷基硫羰基、具有分别独立地选自卤素原子、氰基和 (C_1-C_6) 烷基的1~3个取代基的取代苯基 (C_1-C_6) 烷基硫羰基、N- (C_1-C_6) 烷基氨基硫羰基、N-卤代 (C_1-C_6) 烷基氨基硫羰基、N,N-二 (C_1-C_6) 烷基氨基硫羰基(该基团中 (C_1-C_6) 烷基任选相同或不同)、N- (C_2-C_6) 烯基氨基硫羰基、N- (C_2-C_6) 炔基氨基硫羰基、N- (C_1-C_6) 烷基-N-

[0142] 作为本反应中使用的氧化剂,例如可举出双乙酰氧基碘苯、N-氯琥珀酰亚胺、N-溴琥珀酰亚胺等,这些氧化剂的使用量相对于通式(1-3)表示的化合物可以从1倍摩尔~5倍摩尔的范围适宜选择。

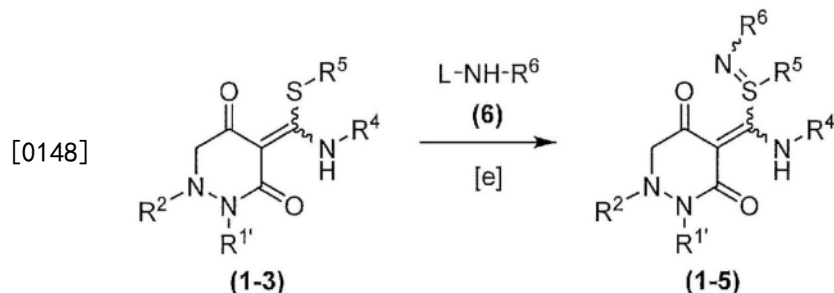
[0143] 作为本反应中可使用的不活泼溶剂,不明显阻碍本反应即可,可举出二乙醚、四氢呋喃、二噁烷等链状或环状醚类、苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等卤代烃类、氯苯、二氯苯等卤化芳香族烃类、乙腈等腈类、乙酸乙酯等酯类、甲酸、乙酸等有机酸类、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮、水等极性溶剂等,这些不活泼溶剂可以单独使用或混合2种以上使用。不活泼溶剂的使用量为使反应试剂溶解的量,就没有特别限定,相对于通式(1-3)表示的化合物1摩尔从0.5L~100L的范围适宜选择即可。

[0144] 本反应为等摩尔反应,因此等摩尔使用各化合物即可,也可以过量使用任一化合物。本反应中的反应温度通常从-10℃出发在使用的不活泼溶剂的回流温度的范围内适宜选择即可,反应时间根据反应规模、反应温度等变化,并不恒定,通常从数分钟~48小时的范围内适宜选择即可。反应结束后,从包含目标产物的反应体系中通过常规方法来分离目标产物即可,可以根据需要用重结晶、柱层析等进行纯化来制造目标产物。

[0145] 制造方法4

[0146] 本发明的通式(1-5)表示的化合物可通过从本发明的通式(1-3)表示的化合物出发,通过下述工序[e]而制造。

[0147] [化学式5]



[0149] 式中, R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 $R^{1'}$ 和L与所述相同。

[0150] 工序[e]的制造方法

[0151] 可通过使通式(1-3)表示的化合物在不活泼溶剂中,与通式(6)表示的化合物反应,而制造本发明的通式(1-5)表示的化合物。

[0152] 作为本反应中可使用的不活泼溶剂,不明显阻碍本反应即可,可举出二乙醚、四氢呋喃、二噁烷等链状或环状醚类、苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等卤代烃类、氯苯、二氯苯等卤化芳香族烃类、乙腈等腈类、乙酸乙酯等酯类、甲酸、乙酸等有机酸类、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮、甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、2-丙醇等醇类、水等极性溶剂等,这些不活泼溶剂可以单独使用或混合2种以上使用。不活泼溶剂的使用量为使反应试剂溶解的量,就没有特别限定,相对于通式(1-3)表示的化合物1摩尔从0.5L~100L的范围适宜选择即可。

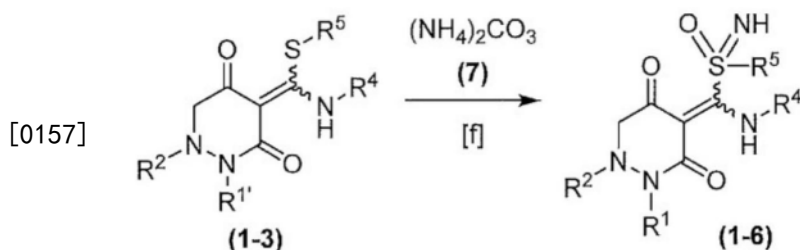
[0153] 本反应为等摩尔反应,因此等摩尔使用各化合物即可,也可以过量使用任一化合物。本反应中的反应温度通常从0℃出发在使用的不活泼溶剂的回流温度的范围内适宜选

择即可。反应时间根据反应规模、反应温度等变化,并不恒定,通常从数分钟~48小时的范围内适宜选择即可。反应结束后,从包含目标产物的反应体系中通过常规方法来分离目标产物即可,可以根据需要用重结晶、柱层析等进行纯化来制造目标产物。

[0154] 制造方法5

[0155] 本发明的通式(1-6)表示的化合物可通过从本发明的通式(1-3)表示的化合物出发,通过下述工序[f]而制造。

[0156] [化学式6]



[0158] 式中, R^2 、 R^4 、 R^5 和 $R^{1'}$ 与前述相同。

[0159] 工序[f]的制造方法

[0160] 可通过使通式(1-3)表示的化合物在不活泼溶剂中,与氧化剂和碳酸铵(7)反应,而制造本发明的通式(1-6)表示的化合物。

[0161] 作为本反应中使用的氧化剂,例如可举出双乙酰氧基碘苯、N-氯琥珀酰亚胺、N-溴琥珀酰亚胺等,这些氧化剂的使用量相对于通式(1-3)表示的化合物可以从1倍摩尔~5倍摩尔的范围适宜选择。

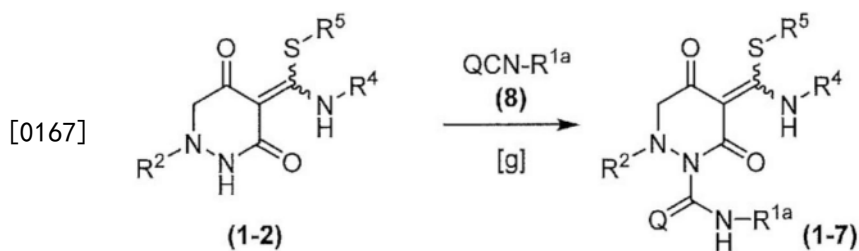
[0162] 作为本反应中可使用的不活泼溶剂,不明显阻碍本反应即可,可举出二乙醚、四氢呋喃、二噁烷等链状或环状醚类、苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等卤代烃类、氯苯、二氯苯等卤化芳香族烃类、乙腈等腈类、乙酸乙酯等酯类、甲酸、乙酸等有机酸类、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮、甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、2-丙醇等醇类、水等极性溶剂等,这些不活泼溶剂可以单独使用或混合2种以上使用。不活泼溶剂的使用量为使反应试剂溶解的量,就没有特别限定,相对于通式(1-3)表示的化合物1摩尔从0.5L~100L的范围适宜选择即可。

[0163] 本反应为等摩尔反应,因此等摩尔使用各化合物即可,也可以过量使用任一化合物。本反应中的反应温度通常从0℃出发在使用的不活泼溶剂的回流温度的范围内适宜选择即可。反应时间根据反应规模、反应温度等变化,并不恒定,通常从数分钟~48小时的范围内适宜选择即可。反应结束后,从包含目标产物的反应体系中通过常规方法来分离目标产物即可,可以根据需要用重结晶、柱层析等进行纯化来制造目标产物。

[0164] 制造方法6

[0165] 本发明的通式(1-7)表示的化合物可通过从本发明的通式(1-2)表示的化合物出发,通过下述工序[g]而制造。

[0166] [化学式7]



[0168] 式中, R^2 、 R^4 和 R^5 与前述相同。 Q 表示氧原子或硫原子。 R^{1a} 表示(C_1 - C_6)烷基、卤代(C_1 - C_6)烷基、(C_2 - C_6)烯基、(C_2 - C_6)炔基、(C_3 - C_6)环烷基、(C_1 - C_6)烷氧基、(C_1 - C_6)烷氧基(C_1 - C_6)烷基、(C_1 - C_6)烷基巯基(C_1 - C_6)烷基、苯基(C_1 - C_6)烷基、具有分别独立地选自卤素原子、氰基、硝基和(C_1 - C_6)烷基的1~3个取代基的取代苯基(C_1 - C_6)烷基、苯基或具有分别独立地选自卤素原子、氰基和(C_1 - C_6)烷基的1~3个取代基的取代苯基。

[0169] 工序[g]的制造方法

[0170] 可通过使本发明的通式(1-2)表示的化合物在碱和不活泼溶剂的存在下,与通式(8)表示的化合物反应,而制造本发明的通式(1-7)表示的化合物。

[0171] 作为本反应中可以使用的碱,例如可举出氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化钙等氢氧化物、甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钠、叔丁醇钾等醇盐、氢化钠、氢化钾等碱金属氢化物类、碳酸锂、碳酸氢锂、碳酸钠、碳酸氢钠、碳酸钾、碳酸氢钾、碳酸钙、碳酸镁、碳酸铯等碳酸盐、乙酸锂、乙酸钠、乙酸钾等乙酸盐、吡啶、甲基吡啶、二甲基吡啶、三乙胺、三丁胺、N,N-二异丙基乙胺等有机碱等,就其使用量而言,相对于通式(1-2)表示的化合物,通常在1倍摩尔~10倍摩尔的范围内使用。

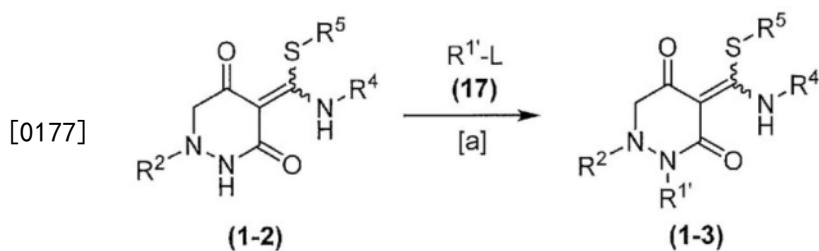
[0172] 作为本反应中可使用的不活泼溶剂,只要不明显阻碍本反应的进行即可,例如可举出戊烷、己烷、环己烷等链状或环状饱和烃类、苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等卤代烃类、氯苯、二氯苯等卤化芳香族烃类、二乙醚、甲基叔丁基醚、二噁烷、四氢呋喃等链状或环状醚类等不活泼溶剂、乙腈、丙腈等腈类、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮等非质子性极性溶剂、甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、2-丙醇等醇类等,这些不活泼溶剂可以单独使用或混合2种以上使用。就其使用量而言,相对于通式(1-2)表示的化合物1摩尔,通常适宜选自0.1~100L的范围内即可。

[0173] 本反应为等摩尔反应,因此等摩尔使用各化合物即可,也可以过量使用任一化合物。本反应中的反应温度通常从约0℃出发在使用的溶剂的沸点的范围内适宜选择即可。反应时间根据反应规模、反应温度等变化,并不恒定,通常从数分钟~48小时的范围内适宜选择即可。反应结束后,从包含目标产物的反应体系中通过常规方法来分离目标产物即可,可以根据需要用重结晶、柱层析等进行纯化来制造目标产物。

[0174] 制造方法7

[0175] 本发明的通式(1-3)表示的化合物可通过从本发明的通式(1-2)表示的化合物出发,通过下述工序[a]而制造。需要说明的是,反应条件与前述相同。

[0176] [化学式8]

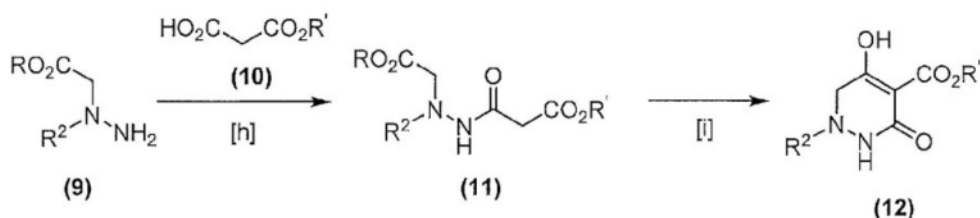


[0178] 式中, $R^{1'}$ 、 R^2 、 R^4 和 R^5 与前述相同。L例如表示氯、溴、碘、 (C_1-C_6) 烷基羰氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰氧基等离去基团。

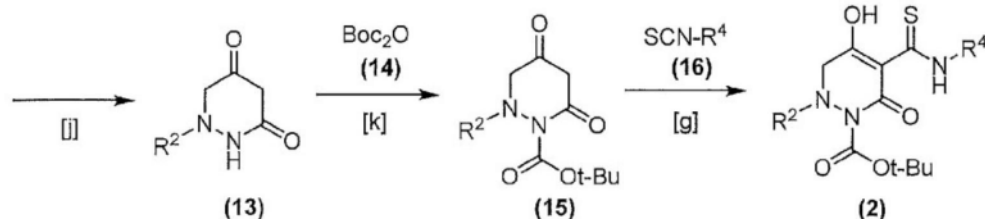
[0179] 起始原料的制造方法1

[0180] 作为起始原料的通式(2)表示的化合物可通过下述制造方法,即从通式(9)表示的化合物出发,通过下述工序[h]、[i]、[j]、[k]和[g]而制造。需要说明的是,[g]的反应条件与前述相同。此外,通式(13)表示的化合物可根据国际公开第2021/261563号小册子所述的方法而制造。

[0181] [化学式9]



[0182]



[0183] 式中, R^2 和 R^4 与前述相同。 R 和 R' 例如表示甲基、乙基等 (C_1-C_6) 烷基。

[0184] 工序[h]的制造方法

[0185] 可通过使通式(9)表示的化合物与通式(10)表示的化合物,通过有机合成中通常使用的酰胺化法而缩合,而制造通式(11)表示的化合物。

[0186] 工序[i]的制造方法

[0187] 可通过使通式(11)表示的化合物在碱和不活泼溶剂的存在下进行环化反应,而制造通式(12)表示的化合物。

[0188] 作为本反应中可以使用的碱,例如可举出氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化钙等氢氧化物、甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钠、叔丁醇钾等醇盐、氢化钠、氢化钾等碱金属氢化物类、碳酸锂、碳酸氢锂、碳酸钠、碳酸氢钠、碳酸钾、碳酸氢钾、碳酸钙、碳酸镁等碳酸盐、乙酸锂、乙酸钠、乙酸钾等乙酸盐、吡啶、甲基吡啶、二甲基吡啶、三乙胺、三丁胺、二异丙基乙胺等有机碱等,就其使用量而言,相对于通式(11)表示的化合物,通常在1倍摩尔~10倍摩尔的范围内使用。

[0189] 作为本反应中可使用的不活泼溶剂,只要不明显阻碍本反应的进行即可,例如可举出戊烷、己烷、环己烷等链状或环状饱和烃类、苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类、氯苯、二氯

苯等卤化芳香族烃类、二乙醚、甲基叔丁基醚、二噁烷、四氢呋喃等链状或环状醚类等不活泼溶剂、乙腈、丙腈等腈类、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砷、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮等非质子性极性溶剂、甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、2-丙醇等醇类等,这些不活泼溶剂可以单独使用或混合2种以上使用。就其使用量而言,相对于通式(11)表示的化合物1摩尔,通常适宜选自0.1~100L的范围内即可。

[0190] 本反应中的反应温度通常从约0℃出发在使用的溶剂的沸点的范围内适宜选择即可。反应时间根据反应规模、反应温度等变化,并不恒定,通常从数分钟~48小时的范围内适宜选择即可。反应结束后,从包含目标产物的反应体系中通过常规方法来分离目标产物即可,可以根据需要用重结晶、柱层析等进行纯化来制造目标产物。

[0191] 工序[j]的制造方法

[0192] 可通过使通式(12)表示的化合物在不活泼溶剂的存在下,在加热条件下反应,而制造通式(13)表示的化合物。

[0193] 作为本反应中可使用的不活泼溶剂,只要不明显阻碍本反应的进行即可,例如可举出戊烷、己烷、环己烷等链状或环状饱和烃类、苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类、氯苯、二氯苯等卤化芳香族烃类、二乙醚、甲基叔丁基醚、二噁烷、四氢呋喃等链状或环状醚类等不活泼溶剂、乙腈、丙腈等腈类、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砷、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮等非质子性极性溶剂、甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、2-丙醇等醇类、水等,这些不活泼溶剂可以单独使用或混合2种以上使用。就其使用量而言,相对于通式(12)表示的化合物1摩尔,通常适宜选自0.1~100L的范围内即可。

[0194] 本反应中的反应温度通常从约0℃出发在使用的溶剂的沸点的范围内适宜选择即可。反应时间根据反应规模、反应温度等变化,并不恒定,通常从数分钟~48小时的范围内适宜选择即可。反应结束后,从包含目标产物的反应体系中通过常规方法来分离目标产物即可,可以根据需要用重结晶、柱层析等进行纯化来制造目标产物。此外,也可以不进行分离而提供给下一个工序。

[0195] 工序[k]的制造方法

[0196] 可通过使通式(13)表示的化合物在碱和不活泼溶剂的存在下,与二碳酸二叔丁酯(6)表示的化合物反应,而制造通式(15)表示的化合物。

[0197] 作为本反应中可使用的碱,例如可举出氢氧化钠、氢氧化钾等碱金属原子的氢氧化物、氢化钠、氢化钾等碱金属的氢化物、乙醇钠、叔丁醇钾等醇的碱金属盐、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠等碳酸盐类等无机碱、三乙胺、吡啶、N,N-二甲基-4-氨基吡啶、DBU等有机碱等,其使用量相对于通式(13)表示的化合物,通常在1倍摩尔~10倍摩尔的范围内使用。

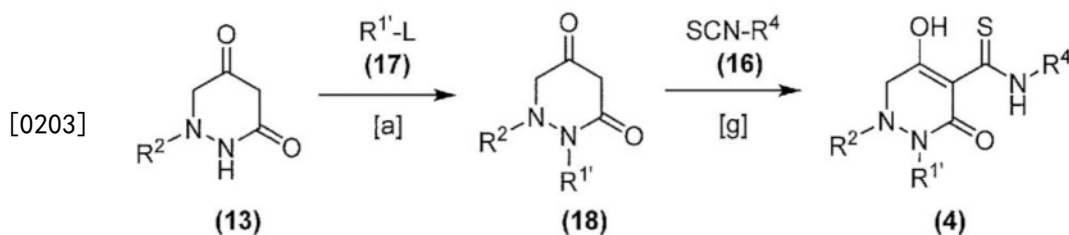
[0198] 作为本反应中可使用的不活泼溶剂,只要不明显阻碍本反应的进行即可,例如可举出戊烷、己烷、环己烷等链状或环状饱和烃类、苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等卤代烃类、氯苯、二氯苯等卤化芳香族烃类、二乙醚、甲基叔丁基醚、二噁烷、四氢呋喃等链状或环状醚类等不活泼溶剂、乙腈、丙腈等腈类、乙酸甲酯等酯类、丙酮、甲基乙基酮等酮类、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砷、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮等非质子性极性溶剂、甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、2-丙醇等醇类等,这些不活泼溶剂可以单独使用或混合2种以上使用。就其使用量而言,相对于通式(13)表示的化合物1摩尔,通常适宜选自0.1~100L的范围内即可。

[0199] 本反应为等摩尔反应,因此等摩尔使用各化合物即可,也可以过量使用任一化合物。本反应中的反应温度通常从0℃出发在使用的溶剂的沸点的范围内适宜选择即可。反应时间根据反应规模、反应温度等变化,并不恒定,通常从数分钟~48小时的范围内适宜选择即可。反应结束后,从包含目标产物的反应体系中通过常规方法来分离目标产物即可,可以根据需要用重结晶、柱层析等进行纯化来制造目标产物。此外,也可以不进行分离而提供给下一个工序。

[0200] 起始原料的制造方法2

[0201] 作为起始原料的通式(4)表示的化合物可通过下述制造方法,即从通式(13)表示的化合物出发,通过下述工序[a]和[g]而制造。需要说明的是,[a]和[g]的反应条件与所述相同。

[0202] [化学式10]

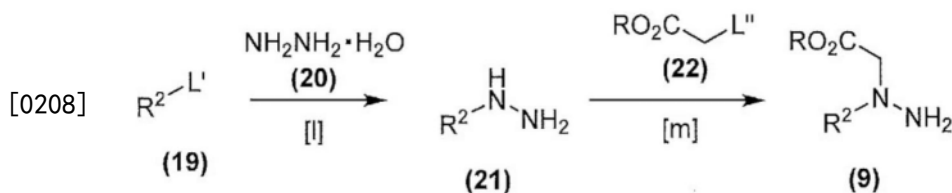


[0204] 式中, R^{1'}、R²和R⁴与前述相同。L例如表示氯、溴、碘、(C₁-C₆) 烷基羰氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰氧基等离去基团。

[0205] 起始原料的制造方法3

[0206] 通式(9)表示的化合物可通过下述制造方法,即从通式(19)表示的化合物出发,通过下述工序[1]和[m]而制造。

[0207] [化学式11]



[0209] 式中, R²和R与前述相同。L' 和L" 例如表示氟、氯、溴、碘等离去基团。

[0210] 工序[1]的制造方法

[0211] 可通过使通式(19)表示的化合物在不活泼溶剂的存在下,与式(20)表示的胍1水合物反应,而制造通式(21)表示的化合物。

[0212] 作为本反应中可使用的不活泼溶剂,只要不明显阻碍本反应的进行即可,例如可举出戊烷、己烷、环己烷等链状或环状饱和烃类、苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类、氯苯、二氯苯等卤化芳香族烃类、二乙醚、甲基叔丁基醚、二噁烷、四氢呋喃等链状或环状醚类等不活泼溶剂、甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、2-丙醇等醇类等,这些不活泼溶剂可以单独使用或混合2种以上使用。就其使用量而言,相对于通式(19)表示的化合物1摩尔,通常适宜选自0.1~100L的范围内即可。

[0213] 本反应为等摩尔反应,因此等摩尔使用各化合物即可,也可以过量使用任一化合物。本反应中的反应温度通常从约0℃出发在使用的溶剂的沸点的范围内适宜选择即可。反

应时间根据反应规模、反应温度等变化,并不恒定,通常从数分钟~48小时的范围内适宜选择即可。反应结束后,从包含目标产物的反应体系中通过常规方法来分离目标产物即可,可以根据需要用重结晶、柱层析等进行纯化来制造目标产物。此外,也可以不进行分离而提供给下一个工序。

[0214] 工序[m]的制造方法

[0215] 可通过使通式(21)表示的化合物在碱和不活泼溶剂的存在下,与通式(22)表示的化合物反应,而制造通式(9)表示的化合物。需要说明的是,可根据国际公开第2021/261563号小册子所述的方法,使通式(21)表示的化合物的 $-\text{NH}_2$ 表示的基团与 $\text{R}''-\text{C}(=\text{O})-\text{R}''$ (R'' 独立地表示甲基、乙基等(C_1-C_6)烷基、苯基等)表示的化合物反应而保护后,进行工序[m],然后进行脱保护。

[0216] 作为本反应中可以使用的碱,例如可举出氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化钙等氢氧化物、甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钠、叔丁醇钾等醇盐、氢化钠、氢化钾等碱金属氢化物类、碳酸锂、碳酸氢锂、碳酸钠、碳酸氢钠、碳酸钾、碳酸氢钾、碳酸钙、碳酸镁、碳酸铯等碳酸盐、乙酸锂、乙酸钠、乙酸钾等乙酸盐、吡啶、甲基吡啶、二甲基吡啶、三乙胺、三丁胺、N,N-二异丙基乙胺等有机碱等,就其使用量而言,相对于通式(21)表示的化合物,通常在1倍摩尔~10倍摩尔的范围内使用。

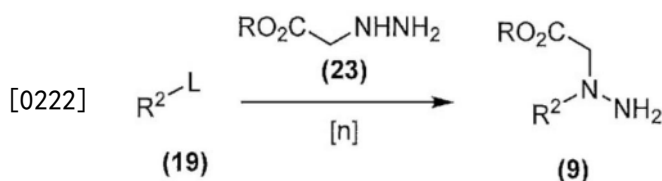
[0217] 作为本反应中可使用的不活泼溶剂,只要不明显阻碍本反应的进行即可,例如可举出戊烷、己烷、环己烷等链状或环状饱和烃类、苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类、氯苯、二氯苯等卤化芳香族烃类、二乙醚、甲基叔丁基醚、二噁烷、四氢呋喃等链状或环状醚类等不活泼溶剂、乙腈、丙腈等腈类、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮等非质子性极性溶剂等,这些不活泼溶剂可以单独使用或混合2种以上使用。就其使用量而言,相对于通式(21)表示的化合物1摩尔,通常适宜选自0.1~100L的范围内即可。

[0218] 本反应为等摩尔反应,因此等摩尔使用各化合物即可,也可以过量使用任一化合物。本反应中的反应温度通常从约0℃出发在使用的溶剂的沸点的范围内适宜选择即可。反应时间根据反应规模、反应温度等变化,并不恒定,通常从数分钟~48小时的范围内适宜选择即可。反应结束后,从包含目标产物的反应体系中通过常规方法来分离目标产物即可,可以根据需要用重结晶、柱层析等进行纯化来制造目标产物。此外,也可以不进行分离而提供给下一个工序。

[0219] 起始原料的制造方法4

[0220] 通式(9)表示的化合物可通过下述制造方法,即从通式(19)表示的化合物出发,通过下述工序[n]而制造。

[0221] [化学式12]



[0223] 式中, R^2 、R和L与所述相同。

[0224] 工序[n]的制造方法

[0225] 可通过使通式(19)表示的化合物在碱和不活泼溶剂的存在下,与通式(23)表示的化合物反应,而制造通式(9)表示的化合物。需要说明的是,可根据国际公开第2021/261563号小册子所述的方法,使通式(23)表示的化合物的 -NH_2 表示的基团与 $\text{R}''\text{-C(=O)-R}''$ (R'' 独立地表示甲基、乙基等($\text{C}_1\text{-C}_6$)烷基、苯基等)表示的化合物反应而保护后,进行工序[n],然后,进行脱保护。

[0226] 作为本反应中可以使用的碱,例如可举出氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化钙等氢氧化物、甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钠、叔丁醇钾等醇盐、氢化钠、氢化钾等碱金属氢化物类、碳酸锂、碳酸氢锂、碳酸钠、碳酸氢钠、碳酸钾、碳酸氢钾、碳酸钙、碳酸镁、碳酸铯等碳酸盐、乙酸锂、乙酸钠、乙酸钾等乙酸盐、吡啶、甲基吡啶、二甲基吡啶、三乙胺、三丁胺、N,N-二异丙基乙胺等有机碱等,就其使用量而言,相对于通式(19)表示的化合物,通常在1倍摩尔~10倍摩尔的范围内使用。

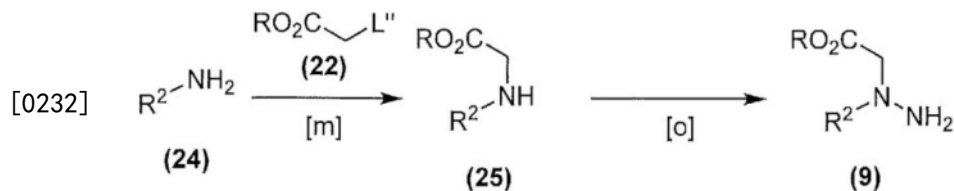
[0227] 作为本反应中可使用的不活泼溶剂,只要不明显阻碍本反应的进行即可,例如可举出戊烷、己烷、环己烷等链状或环状饱和烃类、苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等卤代烃类、氯苯、二氯苯等卤化芳香族烃类、二乙醚、甲基叔丁基醚、二噁烷、四氢呋喃等链状或环状醚类等不活泼溶剂、乙腈、丙腈等腈类、乙酸甲酯等酯类、丙酮、甲基乙基酮等酮类、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮等非质子性极性溶剂、甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、2-丙醇等醇类等,这些不活泼溶剂可以单独使用或混合2种以上使用。就其使用量而言,相对于通式(19)表示的化合物1摩尔,通常适宜选自0.1~100L的范围内即可。

[0228] 本反应为等摩尔反应,因此等摩尔使用各化合物即可,也可以过量使用任一化合物。本反应中的反应温度通常从约0℃出发在使用的溶剂的沸点的范围内适宜选择即可。反应时间根据反应规模、反应温度等变化,并不恒定,通常从数分钟~48小时的范围内适宜选择即可。反应结束后,从包含目标产物的反应体系中通过常规方法来分离目标产物即可,可以根据需要用重结晶、柱层析等进行纯化来制造目标产物。此外,也可以不进行分离而提供给下一个工序。

[0229] 起始原料的制造方法5

[0230] 通式(9)表示的化合物可通过下述制造方法,即从通式(24)表示的化合物出发,通过下述工序[m]和[o]而制造。需要说明的是,[m]的反应条件与所述相同。

[0231] [化学式13]



[0233] 式中, R^2 、R和 L'' 与所述相同。

[0234] 工序[o]的制造方法

[0235] 可通过使通式(25)表示的化合物在酸存在下,与亚硝酸钠反应后,通过还原剂还原,而制造通式(9)表示的化合物。

[0236] 作为本反应中可使用的酸,例如可举出盐酸、硫酸、硝酸等无机酸、甲酸、乙酸、丙酸、三氟乙酸、苯甲酸等有机酸等,其使用量相对于通式(25)表示的化合物在0.01倍摩尔~

10倍摩尔的范围适宜选择即可,该酸也可以用作溶剂。

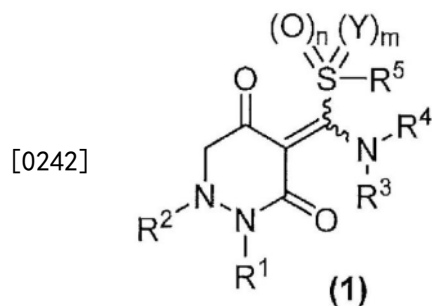
[0237] 作为本反应中使用的还原剂,例如可举出亚硫酸钠、氯化锡等,其使用量相对于通式(25)表示的化合物通常从1.0倍摩尔~10倍摩尔的范围适宜选择即可。

[0238] 本反应中的反应温度通常从约0℃出发在使用的溶剂的沸点的范围内适宜选择即可,反应时间根据反应规模、反应温度等变化,并不恒定,通常从数分钟~48小时的范围内适宜选择即可。反应结束后,从包含目标产物的反应体系中通过常规方法来分离目标产物即可,可以根据需要用重结晶、柱层析等进行纯化来制造目标产物。此外,也可以不分离而提供给下一个工序。

[0239] 在下文中本发明的通式(1)表示的化合物的代表例如第1表~第4表所示,但本发明不限于此。此外,化合物(21)的代表例如第5表所示,化合物(9)的代表例如第6表所示。

[0240] 表中,“Me”表示甲基,“Et”表示乙基,“c-Pr”表示环丙基,“n-Pr”表示正丙基,“t-Bu”表示叔丁基,“Ac”表示乙酰基,“Ph”表示苯基,“Bn”表示苄基,“TMS”表示三甲基甲硅烷基。物理性质表示熔点(℃)、折射率或¹H-NMR。¹H-NMR数据示于第7表。

[0241] [化学式14]



[0243] [表1]

[0244] 第1表(第1表中,R³表示氢原子,n表示0,m表示0。)

[0245]

化合物 编号	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	物性值
1-1	H	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	158-159
1-2	H	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	Et	93-95
1-3	H	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ CN	138-140
1-4	H	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ CF ₃	192-194
1-5	H	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ CH=CH ₂	128-130
1-6	H	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-t-Bu-Bn	59-61
1-7	H	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-Cl-Bn	57-60
1-8	H	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	3-Cl-Bn	88-91
1-9	Ac	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-10	Ac	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-11	CO ₂ Me	3-F-4-CN-Ph	4-F-Ph	Me	
1-12	CO ₂ Me	3-Me-4-CN-Ph	4-F-Ph	Me	111-114
1-13	CO ₂ Me	3-OMe-4-CN-Ph	4-F-Ph	Me	
1-14	CO ₂ Me	4-CN-Ph	4-F-Ph	Me	194-196
1-15	CO ₂ Me	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	116-120
1-16	CO ₂ Me	5-Me-6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	166-169
1-17	CO ₂ Me	6-Br-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	128-129
1-18	CO ₂ Me	6-Cl-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	112-113
1-19	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	Me	Me	
1-20	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	c-Pr	Me	
1-21	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	
1-22	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	CH ₂ C≡CH	Me	
1-23	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	6-OMe-pyridin-3-yl	Me	
1-24	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	6-F-pyridin-3-yl	Me	184-187
1-25	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	6-Cl-pyridin-3-yl	Me	192-194
1-26	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	5-F-pyridin-2-yl	Me	
1-27	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	5-Cl-pyridin-2-yl	Me	
1-28	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-Me-Ph	Me	136-139
1-29	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	185-187
1-30	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Et	150-152

[0246] [表2]

[0247] 第1表(接续)(第1表中,R³表示氢原子,n表示0,m表示0。)

[0248]

化合物 编号	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	物性值
1-31	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ CN	
1-32	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ CF ₃	
1-33	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ CH=CH ₂	
1-34	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Bn	137-141
1-35	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-t-Bu-Bn	156-158
1-36	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-Cl-Bn	161-163
1-37	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	3-Cl-Bn	
1-38	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2-Cl-Bn	142-146
1-39	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-CN-Ph	Me	193-195
1-40	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-Cl-Ph	Me	166-169
1-41	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	3-Me-4-F-Ph	Me	174-177
1-42	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	3,4-F ₂ -Ph	Me	194-196
1-43	COc-Pr	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-44	COc-Pr	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	207-208
1-45	CO ₂ t-Bu	3-F-4-CN-Ph	4-F-Ph	Me	
1-46	CO ₂ t-Bu	3-Me-4-CN-Ph	4-F-Ph	Me	
1-47	CO ₂ t-Bu	3-OMe-4-CN-Ph	4-F-Ph	Me	
1-48	CO ₂ t-Bu	4-CN-Ph	4-F-Ph	Me	
1-49	CO ₂ t-Bu	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-50	CO ₂ t-Bu	5-Me-6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-51	CO ₂ t-Bu	6-Br-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-52	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	Me	Me	
1-53	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	c-Pr	Me	NMR
1-54	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	c-Pr	Bn	66-68
1-55	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	
1-56	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	CH ₂ C≡CH	Me	
1-57	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	6-OMe-pyridin-3-yl	Me	
1-58	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	6-F-pyridin-3-yl	Me	
1-59	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	6-Cl-pyridin-3-yl	Me	
1-60	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	5-F-pyridin-2-yl	Me	

[0249] [表3]

[0250] 第1表(接续)(第1表中,R³表示氢原子,n表示0,m表示0。)

[0251]

化合物 编号	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	物性值
1-61	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	5-Cl-pyridin-2-yl	Me	
1-62	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-Me-Ph	Me	
1-63	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	NMR
1-64	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	Et	118-122
1-65	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ CN	116-120
1-66	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ CF ₃	149-151
1-67	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ CH=CH ₂	85-87
1-68	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-t-Bu-Bn	38-42
1-69	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-Cl-Bn	138-140
1-70	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	3-Cl-Bn	137-140
1-71	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	2-Cl-Bn	1.4656(18.0°C)
1-72	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-CN-Ph	Me	
1-73	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-Cl-Ph	Me	
1-74	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	3-Me-4-F-Ph	Me	
1-75	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	3,4-F ₂ -Ph	Me	
1-76	CO ₂ t-Bu	6-Cl-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-77	CO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-78	CO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	106-108
1-79	CONHEt	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-80	CONHEt	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-81	CONH(c-Pr)	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-82	CONH(c-Pr)	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-83	CSNHEt	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-84	CSNHEt	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-85	CSNH(c-Pr)	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-86	CSNH(c-Pr)	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	

[0252] [表4]

[0253] 第1表(接续)(第1表中,R³表示氢原子,n表示0,m表示0。)

[0254]

化合物 编号	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	物性值
1-87*	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	199-209
1-88*	CO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	265-267
1-89	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	3,5-F ₂ -Ph	Me	171-174
1-90	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	Ph	Me	186-189
1-91	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	3-Me-Ph	Me	124-127
1-92	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-SMe-Ph	Me	125-128
1-93	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-F-Bn	149-151
1-94	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	3,5-(OMe) ₂ -Bn	150-152
1-95	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-OMe-Ph	Me	161-164
1-96	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-CO ₂ Et-Ph	Me	195-198
1-97	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	3-F-Ph	Me	171-174
1-98	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	3-F-Ph	4-CN-Bn	
1-99	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-CO ₂ Me-Bn	131-133
1-100	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-CF ₃ -Bn	135-138
1-101	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-OCF ₃ -Bn	131-133
1-102	CO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	6-CN-pyridin-3-yl	4-OCF ₃ -Ph	Me	131-135
1-103	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-NO ₂ -Bn	141-144
1-104	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	3-Me-Bn	135-138
1-105	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-Br-Bn	121-125
1-106	H	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	181-184
1-107	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	1-Me-pyrazol-4-yl	Me	187-189
1-108	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	1-Me-pyrazol-3-yl	Me	167-169
1-109**	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	187-190
1-110	CO ₂ t-Bu	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	117-118
1-111	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	2-F-Ph	Me	174-177
1-112	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	3,4,5-F ₃ -Ph	Me	159-161
1-113	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	3-F-5-Cl-Ph	Me	141-143
1-114	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	2-F-4-Cl-Ph	Me	
1-115	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	(pyridin-2-yl)CH ₂	
1-116	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	(pyridin-3-yl)CH ₂	
1-117	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	(pyridin-4-yl)CH ₂	

[0255] 第1表中,,*表示钾盐,***表示钠盐。

[0256] [表5]

[0257] 第1表(接续)(第1表中,R³表示氢原子,n表示0,m表示0。)

[0258]

化合物 编号	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	物性值
1-118	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	(naphthalen-1-yl)CH ₂	139-142
1-119	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2-I-Bn	232-235
1-120	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-SCF ₃ -Bn	107-110
1-121	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	(quinolin-2-yl)CH ₂	203-206
1-122	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-CN-Bn	188-191
1-123	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	3-CN-Bn	161-163
1-124	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2-CN-Bn	220-223
1-125	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-SMe-Bn	91-93
1-126	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-SOMe-Bn	
1-127	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-SO ₂ Me-Bn	204-207
1-128	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-NPh ₂ -Bn	152-157
1-129	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-OCHF ₂ -Bn	95-99
1-130	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-c-Pr-Bn	124-128
1-131	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2,4,6-Me ₃ -Bn	124-128
1-132	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2,4-Cl ₂ -Bn	
1-133	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2,6-Cl ₂ -Bn	140-143
1-134	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2,5-Me ₂ -Bn	
1-135	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	3,4-Me ₂ -Bn	
1-136	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2,4-Me ₂ -Bn	163-165
1-137	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2,6-F ₂ -Bn	101-104
1-138	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	3,4-F ₂ -Bn	118-121
1-139	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2,4,6-Cl ₃ -Bn	
1-140	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2-F-6-Cl-Bn	121-123
1-141	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2-Cl-4-F-Bn	127-130
1-142	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	3,4-Cl ₂ -Bn	141-144
1-143	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2,3,4,5,6-Me ₅ -Bn	227-230
1-144	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2-NO ₂ -4-Cl-Bn	
1-145	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	3,5-F ₂ -Bn	109-111
1-146	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2-OPh-Bn	
1-147	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2-F-4-Cl-Bn	

[0259] [表6]

[0260] 第1表(接续)(第1表中,R³表示氢原子,n表示0,m表示0。)

[0261]

化合物 编号	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	物性值
1-148	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	3-Cl-4-F-Bn	105-110
1-149	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	3-Me-4-NO ₂ -Bn	129-134
1-150	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2,5-Cl ₂ -Bn	108-110
1-151	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2-Cl-4,5-F ₂ -Bn	208-213
1-152	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2,3,4,5,6-F ₅ -Bn	174-177
1-153	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2-Cl-5-CF ₃ -Bn	108-112
1-154	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	2-Br-4-CF ₃ -Bn	
1-155	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	3,5-(CF ₃) ₂ -Bn	
1-156	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ CHF ₂	153-155
1-157	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	(naphthalen-2-yl)CH ₂	121-125
1-158	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	(1,3-benzodioxol-5-yl)CH ₂	
1-159	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	(thien-3-yl)CH ₂	91-93
1-160	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	(pyrazol-3-yl)CH ₂	
1-161	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	(oxazol-2-yl)CH ₂	99-103
1-162	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	(imidazol-4-yl)CH ₂	
1-163	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	(1,2,4-oxadiazol-3-yl)CH ₂	
1-164	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	(6-Cl-pyridin-2-yl)CH ₂	169-171
1-165	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	(6-Cl-pyridin-3-yl)CH ₂	136-139
1-166	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	(2-Cl-thiazol-5-yl)CH ₂	106-109
1-167	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	(2-Cl-thiazol-4-yl)CH ₂	122-126
1-168	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	(3-(pyridin-3-yl)- oxadiazol-5-yl)CH ₂	130-133
1-169	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ COMe	
1-170	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ CO(c-Pr)	
1-171	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ COPh	
1-172	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ CO ₂ Et	
1-173	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ CO ₂ (t-Bu)	
1-174	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ CONH ₂	169-173
1-175	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ COCF ₃	
1-176	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ CH ₂ CN	
1-177	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN	

[0262] [表7]

[0263] 第1表(接续)(第1表中,R³表示氢原子,n表示0,m表示0。)

[0264]

化合物 编号	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	物性值
1-178	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ OMe	157-160
1-179	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ SMe	187-189
1-180	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ TMS	127-131
1-181	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	CH ₂ TMS	
1-182	CONH(n-Pr)	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	190-191
1-183	CH ₂ CF ₃	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	198-199
1-184	CH ₂ CHF ₂	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-185	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-CF ₃ -Ph	
1-186	H	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-CF ₃ -Ph	
1-187	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-Cl-Ph	
1-188	H	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-Cl-Ph	
1-189	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-OMe-Ph	
1-190	H	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	4-OMe-Ph	
1-191	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Ph	
1-192	H	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Ph	
1-193	CO ₂ Me	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Et	173-177
1-194	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	CHF ₂	
1-195	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	6-Me- pyridin-2-yl	Me	145-147
1-196	CO ₂ Et	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	114-115
1-197	Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	237-238
1-198	CH ₂ OMe	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	209-210
1-199	SO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-200	SO ₂ Et	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	185-186
1-201	SO ₂ (4-Me- Ph)	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-202	Bn	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	198-199
1-203	CO ₂ Me	5-Me-6-CN-pyridin-3-yl	3-F-Ph	Me	181-184
1-204	CO ₂ Me	5-Me-6-CN-pyridin-3-yl	2-F-Ph	Me	206-209
1-205	CO ₂ Me	5-Me-6-CN-pyridin-3-yl	4-CN-Ph	Me	137-140
1-206	CO ₂ Me	5-Me-6-CN-pyridin-3-yl	4-OMe-Ph	Me	175-178
1-207	CO ₂ Me	5-Me-6-CN-pyridin-3-yl	6-Me- pyridin-2-yl	Me	181-183

[0265] [表8]

[0266] 第1表(接续)(第1表中,R³表示氢原子,n表示0,m表示0。)

[0267]

化合物 编号	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	物性值
1-208	CO ₂ Me	5-F-6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-209	CO ₂ Me	5-F-6-CN-pyridin-3-yl	3,4-F ₂ -Ph	Me	
1-210	CO ₂ Me	5-F-6-CN-pyridin-3-yl	6-Me-pyridin-2-yl	Me	
1-211	CO ₂ Et	5-F-6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	180-182
1-212	CO ₂ Et	5-F-6-CN-pyridin-3-yl	3,4-F ₂ -Ph	Me	
1-213	CO ₂ Et	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	191-193
1-214	CO ₂ Me	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	2,4-F ₂ -Ph	Me	
1-215	CO ₂ Me	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	3,4-F ₂ -Ph	Me	186-188
1-216	CO ₂ Me	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	3,5-F ₂ -Ph	Me	204-206
1-217	CO ₂ Me	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	2-F-4-Cl-Ph	Me	
1-218	CO ₂ Me	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	6-Me-pyridin-2-yl	Me	
1-219	CO ₂ Et	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	2,4-F ₂ -Ph	Me	
1-220	CO ₂ Et	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	3,4-F ₂ -Ph	Me	
1-221	CO ₂ Et	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	3,5-F ₂ -Ph	Me	
1-222	CO ₂ Et	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	2-F-4-Cl-Ph	Me	
1-223	CO ₂ n-Pr	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	180-182
1-224	CO ₂ n-Pr	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	6-Me-pyridin-2-yl	Me	132-135
1-225	CO ₂ Me	5-Br-6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	152-154
1-226	CO ₂ Et	5-Br-6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-227	CO ₂ Me	5-Br-6-CN-pyridin-3-yl	6-Me-pyridin-2-yl	Me	
1-228	CO ₂ Me	5-OMe-6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	186-188
1-229	CO ₂ Et	5-OMe-6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-230	CO ₂ Me	5-OMe-6-CN-pyridin-3-yl	6-Me-pyridin-2-yl	Me	
1-231	CO ₂ Me	5-SMe-6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	120-122
1-232	CO ₂ Me	5-SMe-6-CN-pyridin-3-yl	3,4-F ₂ -Ph	Me	
1-233	CO ₂ Me	5-SMe-6-CN-pyridin-3-yl	6-Me-pyridin-2-yl	Me	
1-234	CO ₂ Et	6-Cl-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	112-113
1-235	CO ₂ Me	6-Cl-pyridin-3-yl	3,4-F ₂ -Ph	Me	NMR
1-236	CO ₂ Et	6-Cl-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Bn	
1-237	CO ₂ Me	6-Cl-pyridin-3-yl	1-Me-pyrazol-4-yl	Me	

[0268] [表9]

[0269] 第1表(接续)(第1表中,R³表示氢原子,n表示0,m表示0。)

[0270]

化合物 编号	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	物性值
1-238	CO ₂ Me	6-Cl-pyridin-3-yl	1-Me-pyrazol-3-yl	Me	
1-239	CO ₂ Me	6-Cl-pyridin-3-yl	6-Me-pyridin-2-yl	Me	
1-240	CO ₂ Me	6-Br-pyridin-3-yl	3-F-Ph	Me	164-165
1-241	CO ₂ Et	6-Br-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-242	CO ₂ Me	6-Br-pyridin-3-yl	1-Me-pyrazol-4-yl	Me	
1-243	CO ₂ Me	6-Br-pyridin-3-yl	1-Me-pyrazol-3-yl	Me	
1-244	CO ₂ Me	6-Br-pyridin-3-yl	6-Me-pyridin-2-yl	Me	
1-245	CO ₂ Et	6-Br-pyridin-3-yl	1-Me-pyrazol-4-yl	Me	
1-246	CO ₂ Et	6-Br-pyridin-3-yl	1-Me-pyrazol-3-yl	Me	
1-247	CO ₂ Et	6-Br-pyridin-3-yl	6-Me-pyridin-2-yl	Me	
1-248	CO ₂ Me	5-CN-pyridin-2-yl	4-F-Ph	Me	95-97
1-249	CO ₂ Et	5-CN-pyridin-2-yl	4-F-Ph	Me	112-114
1-250	CO ₂ Me	5-CN-pyridin-2-yl	6-Me-pyridin-2-yl	Me	
1-251	CO ₂ Me	5-CN-pyridin-2-yl	4-F-Ph	Bn	138-140
1-252	CO ₂ Et	5-CN-pyridin-2-yl	4-F-Ph	Bn	190-192
1-253	CO ₂ Me	5-CN-pyridin-2-yl	3-F-Ph	Me	132-134
1-254	CO ₂ Me	5-Cl-pyridin-2-yl	4-F-Ph	Me	
1-255	CO ₂ Me	5-Cl-pyridin-2-yl	1-Me-pyrazol-4-yl	Me	
1-256	CO ₂ Me	5-Cl-pyridin-2-yl	1-Me-pyrazol-3-yl	Me	
1-257	CO ₂ Me	5-Cl-pyridin-2-yl	6-Me-pyridin-2-yl	Me	
1-258	CO ₂ Me	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	4-F-Ph	Me	
1-259	CO ₂ Me	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	1-Me-pyrazol-4-yl	Me	
1-260	CO ₂ Me	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	1-Me-pyrazol-3-yl	Me	
1-261	CO ₂ Me	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	6-Me-pyridin-2-yl	Me	
1-262	CO ₂ Me	4-CN-Ph	3-F-Ph	Me	196-199
1-263	CO ₂ Me	4-CN-Ph	3-F-Ph	4-CO ₂ Me-Bn	129-132
1-264	CO ₂ Me	4-CN-Ph	3-OMe-Ph	Me	119-121
1-265	CO ₂ Me	4-CN-Ph	3-Me-4-F-Ph	Me	171-174
1-266	CO ₂ Me	4-CN-Ph	5-Cl-pyridin-2-yl	Me	
1-267	CO ₂ Me	4-CN-Ph	6-Cl-pyridin-3-yl	Me	195-198

[0271] [表10]

[0272] 第1表(接续)(第1表中,R³表示氢原子,n表示0,m表示0。)

[0273]

化合物 编号	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	物性值
1-268	CO ₂ Me	4-CN-Ph	6-F-pyridin-3-yl	Me	206-209
1-269	CO ₂ Me	4-CN-Ph	6-Me-pyridin-2-yl	Me	203-206
1-270	CO ₂ Me	4-CN-Ph	6-CN-pyridin-3-yl	Me	
1-271	CO ₂ Me	4-CN-Ph	3,4,5-F ₃ -Ph	Me	229-232
1-272	CO ₂ Me	4-CN-Ph	2-F-Ph	Me	187-190
1-273	CO ₂ Me	4-CN-Ph	3,5-F ₂ -Ph	Me	194-197
1-274	CO ₂ Me	4-CN-Ph	4-Me-Ph	Me	142-145
1-275	CO ₂ Me	4-CN-Ph	3,4,5-F ₃ -Ph	4-CO ₂ Me-Bn	113-116
1-276	CO ₂ Me	4-CN-Ph	2-F-Ph	4-CO ₂ Me-Bn	119-121
1-277	CO ₂ Me	4-CN-Ph	3,5-F ₂ -Ph	4-CO ₂ Me-Bn	116-119
1-278	CO ₂ Me	4-CN-Ph	4-Me-Ph	4-CO ₂ Me-Bn	114-117
1-279	CO ₂ Me	4-CN-Ph	6-Me-pyridin-3-yl	Me	175-178
1-280	CO ₂ Me	4-CN-Ph	5-F-pyridin-2-yl	Me	140-143
1-281	CO ₂ Me	4-CN-Ph	6-OMe-pyridin-3-yl	Me	107-110
1-282	CO ₂ Me	4-CN-Ph	1-Me-pyrazol-4-yl	Me	169-170
1-283	CO ₂ Me	4-CN-Ph	2-F-4-CN-Ph	Me	
1-284	CO ₂ Et	4-CN-Ph	4-F-Ph	Me	169-172
1-285	CO ₂ Et	3-F-4-CN-Ph	4-F-Ph	Me	218-219
1-286	CO ₂ Et	3-F-4-CN-Ph	4-F-Ph	Bn	
1-287	CO ₂ Me	3-F-4-CN-Ph	4-F-Ph	Bn	
1-288	CO ₂ Me	3-F-4-CN-Ph	1-Me-pyrazol-4-yl	Me	
1-289	CO ₂ Me	3-F-4-CN-Ph	1-Me-pyrazol-3-yl	Me	
1-290	CO ₂ Me	3-F-4-CN-Ph	6-Me-pyridin-2-yl	Me	
1-291	CO ₂ Me	3-Cl-4-CN-Ph	4-F-Ph	Me	144-146
1-292	CO ₂ Et	3-Cl-4-CN-Ph	4-F-Ph	Me	
1-293	CO ₂ Me	3-Cl-4-CN-Ph	3-F-Ph	Me	
1-294	CO ₂ Et	3-Cl-4-CN-Ph	3-F-Ph	Me	108-109
1-295	CO ₂ Me	3-Cl-4-CN-Ph	3,4-F ₂ -Ph	Me	
1-296	CO ₂ Me	3-Cl-4-CN-Ph	3,4-F ₂ -Ph	Bn	
1-297	CO ₂ Me	3-Cl-4-CN-Ph	6-Me-pyridin-2-yl	Me	

[0274] [表11]

[0275] 第1表(接续)(第1表中,R³表示氢原子,n表示0,m表示0。)

[0276]

化合物 编号	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	物性值
1-298	CO ₂ Me	3-Br-4-CN-Ph	4-F-Ph	Me	100-101
1-299	CO ₂ Me	3-Br-4-CN-Ph	1-Me-pyrazol-4-yl	Me	
1-300	CO ₂ Me	3-Br-4-CN-Ph	1-Me-pyrazol-3-yl	Me	
1-301	CO ₂ Me	3-Br-4-CN-Ph	6-Me-pyridin-2-yl	Me	
1-302	CO ₂ Et	3-OMe-4-CN-Ph	4-F-Ph	Me	114-117
1-303	CO ₂ Me	3-OMe-4-CN-Ph	6-Me-pyridin-2-yl	Me	167-170
1-304	CO ₂ Me	3-CF ₃ -4-CN-Ph	4-F-Ph	Me	
1-305	CO ₂ Me	3-CF ₃ -4-CN-Ph	6-Me-pyridin-2-yl	Me	
1-306	CO ₂ Me	3,4-(CN) ₂ -Ph	4-F-Ph	Me	176-178
1-307	CO ₂ Me	3,4-(CN) ₂ -Ph	6-Me-pyridin-2-yl	Me	
1-308	CO ₂ Me	4-CF ₃ -Ph	4-F-Ph	Me	
1-309	CO ₂ Me	4-CF ₃ -Ph	1-Me-pyrazol-4-yl	Me	
1-310	CO ₂ Me	4-CF ₃ -Ph	1-Me-pyrazol-3-yl	Me	
1-311	CO ₂ Me	4-CF ₃ -Ph	6-Me-pyridin-2-yl	Me	
1-312	CO ₂ Me	4-OCF ₃ -Ph	4-F-Ph	Me	
1-313	CO ₂ Me	4-OCF ₃ -Ph	1-Me-pyrazol-4-yl	Me	
1-314	CO ₂ Me	4-OCF ₃ -Ph	1-Me-pyrazol-3-yl	Me	
1-315	CO ₂ Me	4-OCF ₃ -Ph	6-Me-pyridin-2-yl	Me	
1-316	CO ₂ Me	4-c-Pr-Ph	4-F-Ph	Me	
1-317	CO ₂ Et	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-318	CO ₂ Me	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	1-Me-pyrazol-4-yl	Me	
1-319	CO ₂ Me	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	1-Me-pyrazol-3-yl	Me	
1-320	CO ₂ Me	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	6-Me-pyridin-2-yl	Me	
1-321	CO ₂ Me	6-Cl-pyridazin-3-yl	4-F-Ph	Me	125-127
1-322	CO ₂ Me	5-CN-pyrimidin-2-yl	4-F-Ph	Me	140-143
1-323	CO ₂ Me	5-(2-Et-tetrazol-5-yl)- pyridin-2-yl	4-F-Ph	Me	
1-324	CO ₂ Me	6-(1-Me-tetrazol-5-yl)- pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	
1-325	CO ₂ Me	6-(SO ₂ NMe ₂)-pyridin-3- yl	4-F-Ph	Me	
1-326	CO ₂ Me	6-ethylsulfonyl-pyridin- 3-yl	4-F-Ph	Me	
1-327	CO ₂ Me	5-Br-pyrazin-2-yl	4-F-Ph	Me	

[0277] [表12]

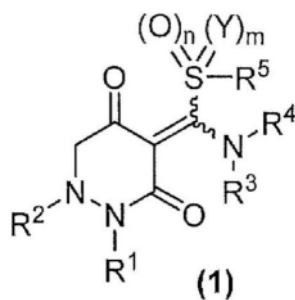
[0278] 第1表(接续)(第1表中,R³表示氢原子,n表示0,m表示0。)

[0279]

化合物 编号	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	物性值
1-328	CO ₂ Et	5-CN-pyridin-2-yl	3-F-Ph	Me	204-205
1-329	CO ₂ Et	5-CN-pyridin-2-yl	3,4,5-F ₃ -Ph	Me	NMR
1-330	CO ₂ Et	5-CN-pyridin-2-yl	3-F-Ph	Bn	NMR
1-331	CO ₂ Me	5-CN-pyridin-2-yl	3,4-F ₂ -Ph	Me	126-127
1-332	CO ₂ Et	5-CN-pyridin-2-yl	3,4-F ₂ -Ph	Me	112-114
1-333	CO ₂ Me	5-Cl-pyridin-2-yl	3-F-Ph	Me	NMR
1-334	CO ₂ Me	5-Cl-pyridin-2-yl	3-F-Ph	Bn	NMR
1-335	CO ₂ Et	6-Cl-pyridin-3-yl	3,4-F ₂ -Ph	Me	113-114
1-336	CO ₂ Me	6-Br-pyridin-3-yl	3,4-F ₂ -Ph	Me	116-117
1-337	CO ₂ Et	3-F-4-CN-Ph	3,4-F ₂ -Ph	Me	207-208
1-338	CO ₂ Et	3-Me-4-CN-Ph	4-F-Ph	Me	121-124
1-339	CO ₂ Me	3-Me-4-CN-Ph	6-Me-pyridin-2-yl	Me	179-182
1-340	Et	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	171-172
1-341	CH ₂ CN	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	179-180
1-342	CH ₂ (c-Pr)	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	210-211
1-343	(2-Cl-thiazol-5-yl)CH ₂	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	231-232
1-344	H	5-SMe-6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	129-131
1-345	CO ₂ Me	5-Br-6-(aminocarbonyl)-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	135-137

[0280] [化学式15]

[0281]



[0282] [表13]

[0283] 第2表(第2表中,n表示0,m表示0。)

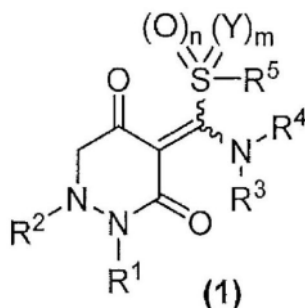
[0284]

化合物 编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁴	物性值
2-1	CO ₂ Me	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	-C(=O)CH ₂ CH ₂ -		4-F-Ph	
2-2	CO ₂ Me	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	-C(=O)CH ₂ -		4-F-Ph	
2-3	CO ₂ Me	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		4-F-Ph	
2-4	CO ₂ Me	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	-CH ₂ CH ₂ -		4-F-Ph	
2-5	CO ₂ Me	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)-		4-F-Ph	
2-6	CO ₂ Me	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	-CH ₂ C(=O)-		4-F-Ph	
2-7	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	-C(=O)CH ₂ CH ₂ -		4-F-Ph	168-171
2-8	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	-C(=O)CH ₂ -		4-F-Ph	161-166
2-9	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		4-F-Ph	
2-10	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	-CH ₂ CH ₂ -		4-F-Ph	
2-11	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)-		4-F-Ph	
2-12	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	-CH ₂ C(=O)-		4-F-Ph	
2-13	CO ₂ Me	4-CN-Ph	-C(=O)CH ₂ CH ₂ -		4-F-Ph	
2-14	CO ₂ Me	4-CN-Ph	-C(=O)CH ₂ -		4-F-Ph	
2-15	CO ₂ Me	5-Br-6-CN-pyridin-3-yl	-C(=O)CH ₂ CH ₂ -		4-F-Ph	
2-16	CO ₂ Me	5-Br-6-CN-pyridin-3-yl	-C(=O)CH ₂ -		4-F-Ph	
2-17	CO ₂ Me	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	-C(=O)CH ₂ CH ₂ -		4-F-Ph	
2-18	CO ₂ Me	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	-C(=O)CH ₂ -		4-F-Ph	
2-19	CO ₂ Me	5-F-6-CN-pyridin-3-yl	-C(=O)CH ₂ CH ₂ -		4-F-Ph	
2-20	CO ₂ Me	5-F-6-CN-pyridin-3-yl	-C(=O)CH ₂ -		4-F-Ph	
2-21	CO ₂ Me	6-Cl-pyridin-3-yl	-C(=O)CH ₂ CH ₂ -		4-F-Ph	
2-22	CO ₂ Me	6-Cl-pyridin-3-yl	-C(=O)CH ₂ -		4-F-Ph	
2-23	CO ₂ Me	6-Br-pyridin-3-yl	-C(=O)CH ₂ CH ₂ -		4-F-Ph	
2-24	CO ₂ Me	6-Br-pyridin-3-yl	-C(=O)CH ₂ -		4-F-Ph	
2-25	CO ₂ Me	3-Cl-4-CN-Ph	-C(=O)CH ₂ CH ₂ -		4-F-Ph	
2-26	CO ₂ Me	3-Cl-4-CN-Ph	-C(=O)CH ₂ -		4-F-Ph	
2-27	CO ₂ Me	3-F-4-CN-Ph	-C(=O)CH ₂ CH ₂ -		4-F-Ph	
2-28	CO ₂ Me	3-F-4-CN-Ph	-C(=O)CH ₂ -		4-F-Ph	
2-29	CO ₂ Me	5-CN-pyridin-2-yl	-C(=O)CH ₂ CH ₂ -		4-F-Ph	
2-30	CO ₂ Me	5-CN-pyridin-2-yl	-C(=O)CH ₂ -		4-F-Ph	
2-31	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	-C(=O)CH ₂ CH ₂ -		4-F-Ph	134-137
2-32	CO ₂ t-Bu	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	-C(=O)CH ₂ -		4-F-Ph	
2-33	H	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	-C(=O)CH ₂ CH ₂ -		4-F-Ph	170-172
2-34	H	6-CF ₃ -pyridin-3-yl	-C(=O)CH ₂ -		4-F-Ph	

[0285] 第2表中,在R³和R⁵中,左侧的“-”表示与R³的键合位置,右侧的“-”表示[0286] 与R⁵的键合位置。

[0287] [化学式16]

[0288]



[0289] [表14]

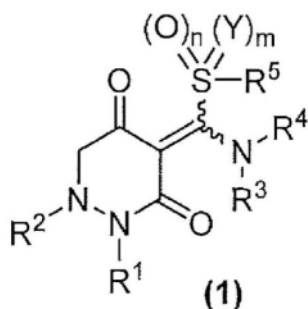
[0290] 第3表(第3表中,n表示0,m表示0。)

[0291]

化合物编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物性值
3-1	CO ₂ Me	5-CN-pyrimidin-2-yl	Me	4-F-Ph	Me	166-170
3-2	CO ₂ Me	5-Br-6-CN-pyridin-3-yl	Me	4-F-Ph	Me	135-138
3-3	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	Me	4-F-Ph	Me	182-185
3-4	H	5-SMe-6-CN-pyridin-3-yl	CO ₂ Me	4-F-Ph	Me	174-176

[0292] [化学式17]

[0293]



[0294] [表15]

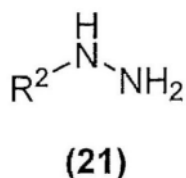
[0295] 第4表(第4表中,R³表示氢原子。)

[0296]

化合物编号	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	Y	n	m	物性值
4-1	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	—	1	0	
4-2	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	O	1	1	
4-3	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	NH	0	1	
4-4	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	NAc	0	1	
4-5	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	NCO ₂ Et	0	1	
4-6	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	NCN	0	1	
4-7	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	NMe	0	1	
4-8	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	NSO ₂ Ph	0	1	
4-9	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	NSO ₂ -4-Me-Ph	0	1	
4-10	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	NH	1	1	
4-11	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	NAc	1	1	
4-12	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	NCO ₂ Et	1	1	
4-13	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	NCN	1	1	
4-14	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	NMe	1	1	
4-15	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	NSO ₂ Ph	1	1	
4-16	CO ₂ Me	6-CN-pyridin-3-yl	4-F-Ph	Me	NSO ₂ -4-Me-Ph	1	1	

[0297] [化学式18]

[0298]



[0299] [表16]

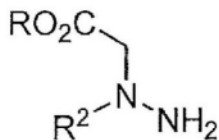
[0300] 第5表

[0301]

化合物编号	R ²	物性值
5-1	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	NMR
5-2	5-Me-6-CN-pyridin-3-yl	

5-3	5-F-6-CN-pyridin-3-yl	
5-4	5-Br-6-CN-pyridin-3-yl	227-229
5-5	5-OMe-6-CN-pyridin-3-yl	
5-6	5-SMe-6-CN-pyridin-3-yl	
5-7	5-(2-Et-tetrazol-5-yl)-pyridin-2-yl	
5-8	6-(1-Me-tetrazol-5-yl)-pyridin-3-yl	
5-9	6-((Dimethylamino)sulfonyl)-pyridin-3-yl	
5-10	6-ethylsulfonyl-pyridin-3-yl	

[0302] [化学式19]



[0303]

(9)

[0304] [表17]

[0305] 第6表

[0306]

化合物编号	R ²	R	物性值
6-1	3-F-4-CN-Ph	Et	NMR
6-2	3-Me-4-CN-Ph	Et	NMR
6-3	3-OMe-4-CN-Ph	Et	NMR
6-4	4-CN-Ph	Et	NMR
6-5	5-Cl-6-CN-pyridin-3-yl	Et	NMR
6-6	5-Me-6-CN-pyridin-3-yl	Et	NMR
6-7	5-F-6-CN-pyridin-3-yl	Et	NMR
6-8	5-Br-6-CN-pyridin-3-yl	Et	NMR
6-9	5-OMe-6-CN-pyridin-3-yl	Et	108-110
6-10	5-SMe-6-CN-pyridin-3-yl	Et	
6-11	6-Br-pyridin-3-yl	Et	NMR
6-12	6-Cl-pyridin-3-yl	Et	NMR
6-13	6-CN-pyridin-3-yl	Et	NMR
6-14	5-CN-pyridin-2-yl	Et	NMR
6-15	5-Cl-pyridin-2-yl	Et	NMR
6-16	5-CF ₃ -pyridin-2-yl	Et	
6-17	3-Cl-4-CN-Ph	Et	NMR
6-18	3-Br-4-CN-Ph	Et	
6-19	3-CF ₃ -4-CN-Ph	Et	NMR
6-20	3,4-(CN) ₂ -Ph	Et	NMR
6-21	4-CF ₃ -Ph	Et	NMR
6-22	4-OCF ₃ -Ph	Et	NMR

6-23	4-c-Pr-Ph	Et	
6-24	6-Cl-pyridazin-3-yl	Et	NMR
6-25	5-CN-pyrimidin-2-yl	Et	86-87
6-26	5-(2-Et-tetrazol-5-yl)-pyridin-2-yl	Et	
6-27	6-(1-Me-tetrazol-5-yl)-pyridin-3-yl	Et	NMR
6-28	6-((Dimethylamino)sulfonyl)-pyridin-3-yl	Et	
6-29	6-ethylsulfonyl-pyridin-3-yl	Et	NMR
6-30	5-Br-pyrazin-2-yl	Et	

[0307] [表18]

[0308] 第7表

化合物 编号	¹ H-NMR 数据
1-53	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 11.6(s, 1H), 8.34(d, 1H), 7.57(d, 1H), 7.28(d, 1H), 4.31(dd, 2H), 2.87-2.84(m, 1H), 2.19(s, 3H), 1.54(s, 9H), 1.01-0.92(m, 2H), 0.83-0.75(m, 2H)
1-63	¹ H-NMR(DMSO-d ₆ /TMS, ppm) δ 8.19(d, 1H), 7.57(d, 1H), 7.21(d, 1H), 6.79-6.63(brs, 4H), 4.25-3.85(brs, 2H), 2.11(s, 3H), 1.41(s, 9H)
1-235	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 13.6(1H, br), 8.07-8.06(1H, m), 7.28-6.99(5H, m), 4.34(2H, br), 3.95(3H, s), 2.08(3H, s)
1-329	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 13.6 (1H, br), 8.52 (1H, d), 7.82(1H, dd), 6.99-6.94(3H, m), 6, 60-6.57(1H, m), 5.47(1H, d), 4.45-4.36(4H, m), 2.15(3H, s), 1.37(3H, t)
1-330	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 13.7(1H, br), 8.51(1H, d), 7.76(1H, dd), 7.38-7.32(1H, m), 7.23-7.13(3H, m), 7.05-6.88(6H, m), 5.48(1H, d), 4.46-4.37(2H, m), 4.16-4.09(2H, m), 3.95(1H, d), 3.58(1H, d), 1.37(3H, t)
1-333	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 13.7(1H, br), 8.18(1H, d), 7.55(1H, dd), 7.41-7.35(1H, m), 7.07-6.99(3H, m), 6.88(1H, d), 5.30(1H, d), 4.12(2H, q), 3.96(3H, s), 2.06(3H, s)
1-334	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 13.7(1H, br), 8.19(1H, d), 7.52(1H, d), 7.36-7.30(2H, m), 7.24-7.14(3H, m), 7.03-6.97(2H, m), 6.92(2H, d), 6.84(2H, d), 5.32(1H, d), 4.90(1H, d), 3.96(3H, s), 3.91(1H, d), 3.53(1H, d)
5-1	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 8.51(1H, s), 8.05(1H, s), 7.23(1H, s), 4.55(2H, s)
6-1	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 7.42-7.32 (m, 1H), 6.82-6.72 (m, 1H), 6.68-6.41 (1H, m), 4.27 (2H, s), 4.25-4.17 (2H, m)
6-2	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 7.44 (1H, d), 6.81 (1H, d), 6.72 (1H, dd), 4.29 (2H, s), 4.21 (2H, q), 4.08 (2H, s), 2.48 (3H, s), 1.27 (3H, t)
6-3	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 7.36 (1H, d), 6.67 (1H, d), 6.33 (1H, dd), 4.28 (2H, s), 4.22 (2H, q), 4.09 (2H, s), 3.91 (1H, s), 1.27 (3H, t)
6-4	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 8.95 (br, 1H), 7.53 (2H, d), 6.84 (2H, d), 4.34 (2H, s), 4.29-4.21 (4H, m)
6-5	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 8.21(1H, s), 7.39(1H, s), 4.30(2H, s), 4.25(2H, dd), 4.16(2H, s), 1.31(3H, t)
6-6	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 8.19 (1H, d), 7.13 (1H, d), 4.30 (2H, s), 4.23 (2H, q), 4.18-4.00 (2H, br, s), 2.48 (3H, s), 1.29 (3H, t)
6-7	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 8.14(1H, s), 7.15(1H, d), 4.31(2H, s), 4.25(2H, dd), 4.17(2H, s), 1.32(3H, t)
6-8	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 8.25(1H, s), 7.56(1H, s), 4.36(2H, s), 4.25(2H, dd), 4.16(2H, s), 1.32(3H, t)

[0309] [表19]

[0310] 第7表(接续)

[0311]

化合物 编号	¹ H-NMR 数据
6-11	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 8.02 (1H, d), 7.29 (1H, dd), 7.21 (1H, dd), 4.21 (2H, s), 4.20 (2H, q), 4.07 (2H, s), 1.26 (3H, t)
6-12	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 8.02 (1H, d), 7.30 (1H, dd), 7.15 (1H, d), 4.21 (2H, s), 4.20 (2H, q), 4.07 (2H, s)
6-13	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 8.39 (1H, dd), 7.51 (1H, dd), 7.27 (1H, d), 4.31 (2H, s), 4.23 (2H, q), 4.16 (2H, s), 1.29 (3H, t)
6-14	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 8.35 (1H, dd), 7.67 (1H, dd), 7.30 (1H, d), 4.61 (2H, s), 4.22 (2H, q), 4.15 (2H, s), 1.29 (3H, t)
6-15	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 8.03 (1H, d), 7.46 (1H, dd), 7.14 (1H, d), 4.50 (2H, s), 4.19 (2H, q), 4.10 (2H, s), 1.26 (3H, t)
6-17	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 7.46 (1H, d), 7.08 (1H, d), 6.78 (1H, dd), 4.28 (2H, s), 4.23 (2H, q), 4.10 (2H, s), 1.28 (3H, t)
6-19	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 7.62 (1H, d), 7.39 (1H, d), 7.00 (1H, dd), 4.33 (2H, s), 4.23 (2H, q), 4.14 (2H, s), 1.29 (3H, t)
6-20	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 7.57 (1H, d), 7.38 (1H, d), 7.11 (1H, dd), 4.31 (2H, s), 4.28 (2H, q), 4.14 (2H, s), 1.30 (3H, t)
6-21	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 7.47 (2H, d), 6.94 (2H, d), 4.29 (2H, s), 4.19 (2H, q), 4.09 (2H, br)
6-22	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 7.10 (2H, d), 6.92-6.86 (2H, m), 4.33-4.01 (2H, br, s), 4.24 (2H, s), 4.19 (2H, q), 1.25 (2H, t)
6-24	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 7.64 (1H, d), 7.25 (1H, d), 4.66 (2H, s), 4.21 (2H, q), 4.17 (2H, s), 1.28 (3H, t)
6-27	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 8.49(1H, d), 8.18(1H, d), 7.38(1H, dd), 4.45(3H, s), 4.39(2H, s), 4.24(2H, q), 4.17(2H, brs), 1.29(3H, t)
6-29	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, ppm) δ 8.40 (1H, d), 7.87 (1H, d), 7.32 (1H, dd), 4.33 (2H, s), 4.23 (2H, q), 4.19 (2H, s), 3.30 (2H, q), 1.31-1.24 (6H, m)

[0312] 将本发明的通式(1)表示的化合物或其盐类作为有效成分而含有的农艺园艺用杀虫剂适用于危害水稻、果树、蔬菜、其他作物和花卉类的各种农林、园艺、储粮害虫、卫生害虫或者线虫类等的害虫防治。

[0313] 此外,将本发明的通式(1)表示的化合物或其盐类作为有效成分而含有的农艺园艺用杀虫剂在适用于各种省力的施用方法的物性、渗透转移活性、适当的土壤残留性等环境安全性的方面是优异的。

[0314] 此外,将本发明的通式(1)表示的化合物或其盐类作为有效成分而含有的农艺园艺用杀虫剂对天敌/西洋蜜蜂(*Apis mellifera*)、大黄蜂(*Bombus* sp.)等有用昆虫/摇蚊科等环境生物的影响较少。

[0315] 作为所述害虫或线虫类等,列举如下。

[0316] 作为鳞翅目(Lepidoptera)害虫,例如可举出:褐边绿刺蛾(*Parasa consocia*)、桥夜蛾(*Anomis mesogona*)、柑橘凤蝶(*Papilio xuthus*)、日豆小卷蛾(*Matsumuraeses azukivora*)、麻田豆秆野螟(*Ostrinia scapulalis*)、非洲粘虫(*Spodoptera exempta*)、美国白蛾(*Hyphantria cunea*)、亚洲玉米螟(*Ostrinia furnacalis*)、东方粘虫(*Pseudaletia separata*)、*Tinea translucens*、尖翅小卷蛾(*Bactra furfuryla*)、稻苞虫(*Parnara guttata*)、稻显纹刷须野螟(*Marasmia exigua*)、水稻大螟(*Sesamia inferens*)、甘薯麦蛾(*Brachmia triannulella*)、黄刺蛾(*Monema flavescens*)、粉纹夜蛾(*Trichoplusia ni*)、*Pleuroptya ruralis*、小蜻蜓尺蛾(*Cystidia couaggaria*)、亮灰蝶(*Lampides boeticus*)、咖啡透翅天蛾(*Cephonodes hylas*)、棉铃虫(*Helicoverpa armigera*)、曼蚕舟蛾(*Phalerodonta manleyi*)、大避债蛾(*Eumeta japonica*)、欧洲粉蝶(*Pieris brassicae*)、

天幕毛虫 (*Malacosoma neustria testacea*)、柿举肢蛾 (*Stathmopoda masinissa*)、柿细蛾 (*Cuphodes diospyrosella*)、柞黄卷蛾 (*Archips xylosteanus*)、黄地老虎 (*Agrotis segetum*)、甘蔗黄螟 (*Tetramoera schistaceana*)、黄凤蝶 (*Papilio machaon hippocrates*)、黄斑蝙蝠蛾 (*Endoclyta sinensis*)、银纹潜蛾 (*Lyonetia prunifoliella*)、金纹小潜细蛾 (*Phyllonorycter ringoneella*)、栗白小卷蛾 (*Cydia kurokoi*)、栗绿小卷蛾 (*Eucoenogenes aestuosa*)、葡萄花翅小卷蛾 (*Lobesia botrana*)、中国绿刺蛾 (*Latoia sinica*)、皮暗斑螟 (*Euzophera batangensis*)、慈姑褐纹卷蛾 (*Phalonidia mesotypa*)、桑斑灯蛾 (*Spilosomaimparilis*)、桑绢野螟 (*Glyphodes pyloalis*)、桑新小卷蛾 (*Olethreutes mori*)、幕谷蛾 (*Tineola bisselliella*)、蝙蝠蛾 (*Endoclyta excrescens*)、谷蛾 (*Nemapogon granellus*)、苹果透翅蛾 (*Synanthedon hector*)、苹果蠹蛾 (*Cydia pomonella*)、小菜蛾 (*Plutella xylostella*)、稻纵卷叶野螟 (*Cnaphalocrocis medinalis*)、*Sesamiacalamistis*、三化螟 (*Scirpophaga incertulas*)、蓝草螟蛾 (*Pediasia teterrellus*)、马铃薯块茎蛾 (*Phthorimaea operculella*)、苹蚁舟蛾 (*Stauropus fagi persimilis*)、豆荚螟 (*Etiella zinckenella*)、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua*)、白斑蝙蝠蛾 (*Palpifer sexnotata*)、灰翅夜蛾 (*Spodoptera mauritia*)、稻白螟 (*Scirpophaga innotata*)、八字地老虎 (*Xestia c-nigrum*)、淡剑贪夜蛾 (*Spodoptera depravata*)、地中海斑螟 (*Ephestia kuehniella*)、李尺蛾 (*Angerona prunaria*)、分月扇舟蛾 (*Clostera anastomosis*)、大豆夜蛾 (*Pseudoplusia includens*)、松村氏卷蛾 (*Matsumuraeses falcana*)、烟夜蛾 (*Helicoverpa assulta*)、黑点丫纹夜蛾 (*Autographa nigrisigna*)、小地老虎 (*Agrotis ipsilon*)、茶毒蛾 (*Euproctis pseudoconsersa*)、棉褐带卷蛾 (*Adoxophyes orana*)、茶细蛾 (*Caloptilia theivora*)、茶长卷蛾 (*Homona magnanima*)、烟草粉斑螟 (*Ephestia elutella*)、茶蓑蛾 (*Eumeta minuscula*)、杨扇舟蛾 (*Clostera anachoreta*)、苇实夜蛾 (*Heliothis maritima*)、葡萄长须卷蛾 (*Sparganothispilleriana*)、玉米茎夜蛾 (*Busseola fusca*)、东方毒蛾 (*Euproctis subflava*)、褐纹大尺蛾 (*Biston robustum*)、美洲棉铃虫 (*Heliothis zea*)、白斑烦夜蛾 (*Aedia leucomelas*)、梨娜刺蛾 (*Narosoideus flavidorsalis*)、梨剑纹夜蛾 (*Viminia rumicis*)、*Bucculatrix pyrivorella*、梨小食心虫 (*Grapholita molesta*)、梨潜皮蛾 (*Spulerinaaasturota*)、梨云翅斑螟 (*Ectomyelois pyrivorella*)、二化螟 (*Chilo suppressalis*)、葱菜蛾 (*Acrolepiopsis sapporensis*)、印度谷螟 (*Plodia interpunctella*)、菜心野螟蛾 (*Hellula undalis*)、麦蛾 (*Sitotroga cerealella*)、斜纹夜蛾 (*Spodoptera litura*)、绿豆芽蛾 (*Eucosma aporema*)、草莓长翅卷蛾 (*Acleris comariana*)、纵带球须刺蛾 (*Scopelodes contractus*)、旋古毒蛾 (*Orgyia thyellina*)、草地夜蛾 (*Spodopterafrugiperda*)、*Ostrinia zaguliaevi*、双带夜蛾 (*Naranga aenescens*)、茶蚕蛾 (*Andraca bipunctata*)、葡萄透翅蛾 (*Paranthrene regalis*)、缺角天蛾 (*Acosmeryx castanea*)、葡萄潜叶蛾 (*Phyllocnistis toparcha*)、葡萄小食心虫 (*Endopiza viteana*)、环针单纹卷蛾 (*Eupoecillia ambiguella*)、大豆夜蛾 (*Anticarsia gemmatalis*)、烟草云卷蛾 (*Cnephasia cinereipalpana*)、舞毒蛾 (*Lymantria dispar*)、赤松毛虫 (*Dendrolimus spectabilis*)、大豆食心虫 (*Leguminivora glycinivorella*)、豆荚野螟 (*Maruca testulalis*)、豆小卷蛾 (*Matsumuraeses phaseoli*)、大豆花细蛾 (*Caloptilia soyella*)、柑橘潜叶蛾 (*Phyllocnistis citrella*)、豆啮叶野螟

(*Omiodes indicate*)、杏黄卷蛾(*Archips fuscocupreanus*)、银纹夜蛾(*Acanthopplusia agnata*)、黑艳避债蛾(*Bambalina sp.*)、桃蛀果蛾(*Carposina niponensis*)、桃蛀螟(*Conogethes punctiferalis*)、榆透翅蛾(*Synanthedon sp.*)、桃潜蛾(*Lyonetia clerkella*)、玉斑凤蝶(*Papilio helenus*)、斑缘豆粉蝶(*Colias erate poliographus*)、苹掌舟蛾(*Phalera flavescens*)、日本纹白蝶(*Pieris rapae crucivora*)、菜粉蝶(*Pieris rapae*)等粉蝶类、桑毛虫(*Euproctis similis*)、铃木凤眼蜂(*Acrolepiopsis suzukiella*)、玉米螟(*Ostrinia nubilalis*)、甘蓝夜蛾(*Mamestra brassicae*)、大造桥虫(*Ascotis selenaria*)、艾草大细卷叶蛾(*Phtheochroides clandestina*)、北川卷蛾(*Hoshinoa adumbratana*)、*Odonestis pruni japonensis*、*Triaena intermedia*、苹小卷叶蛾(*Adoxophyes orana fasciata*)、苹小食心虫(*Grapholita inopinata*)、苹白小卷蛾(*Spilonota ocellana*)、顶梢卷叶蛾(*Spilonota lechriaspis*)、梨星毛虫(*Illiberis pruni*)、*Argyresthia conjugella*、猛花细蛾(*Caloptilia zachrysa*)、梨黄卷蛾(*Archips breviplicanus*)、小造桥夜蛾(*Anomis flava*)、棉红铃虫(*Pectinophora gossypiella*)、棉大卷叶野螟(*Notarcha derogata*)、瓜绢野螟(*Diaphania indica*)、烟芽夜蛾(*Heliothis virescens*)和鼎点钻夜蛾(*Earias cupreoviridis*)等。

[0317] 作为半翅目(Hemiptera)害虫,例如可举出:黑须稻绿蝽(*Nezara antennata*)、赤条纤盲蝽(*Stenotus rubrovittatus*)、赤条蝽(*Graphosoma rubrolineatum*)、条赤须盲蝽(*Trigonotylus coelestialium*)等、黄伊缘蝽(*Aeschynteles maculatus*)、*Creontiades pallidifer*、棉二点红蝽(*Dysdercus cingulatus*)、褐圆介壳虫(*Chrysomphalus ficus*)、红圆蚧(*Aonidiella aurantii*)、油蝉(*Graptopsaltria nigrofuscata*)、麦长蝽(*Blissus leucopterus*)、吹绵蚧壳虫(*Icerya purchasi*)、壁蝽(*Piezodorus hybneri*)、稻蝽象(*Lagynotomus elongatus*)、白翅叶蝉(*Thaia subrufa*)、稻黑蝽(*Scotinophara lurida*)、玫瑰蚜(*Sitobion ibarae*)、*Stariodes iwasakii*、椰圆盾蚧(*Aspidiotus destructor*)、淡色泰盲蝽(*Taylorilygus pallidulus*)、杏瘤蚜(*Myzasmumecola*)、梅白蚧(*Pseudaulacaspis prunicola*)、豌豆蚜(*Acyrtosiphon pisum*)、纹须同缘椿象(*Anacanthocoris striicornis*)、跃盲蝽(*Ectometopterus micantulus*)、日本二星蝽(*Eysarcoris lewisi*)、巨叶足虫(*Molipteryx fuliginosa*)、大青叶蝉(*Cicadella viridis*)、红腹缢管蚜(*Rhopalosiphum rufiabdominalis*)、橄榄黑盔蚧(*Saissetia oleae*)、温室粉虱(*Trialeurodes vaporariorum*)、*Aguriahana quercus*、草盲蝽属(*Lygus spp.*)、桦绵斑蚜(*Euceraphis punctipennis*)、柑橘介壳虫(*Andaspis kashicola*)、橘软蜡蚧(*Coccus pseudomagnoliarum*)、甘蔗长蝽(*Cavelerius saccharivorus*)、菊贝脊网蝽(*Galeatus spinifrons*)、光褐菊蚜(*Macrosiphoniella sanborni*)、黄圆蹄盾蚧(*Aonidiella citrina*)、茶翅蝽(*Halyomorpha mista*)、冠网蝽(*Stephanitis fasciicarina*)、樟个木虱(*Trioza camphorae*)、中稻缘蝽(*Leptocoris chinensis*)、*Trioza quercicola*、褐角肩网蝽(*Uhlerites latius*)、葡萄斑叶蝉(*Erythroneura comes*)、*Paromius exiguus*、柘柳重圆盾蚧(*Duplaspidiotus claviger*)、二条斑黑尾叶蝉(*Nephotettix nigropictus*)、*Halticiellus insularis*、甘蔗扁角飞虱(*Perkinsiella saccharicida*)、苹果木虱(*Psylla malivorella*)、桑木虱(*Anomomeura mori*)、长尾粉蚧(*Pseudococcus longispinis*)、桑白盾蚧(*Pseudaulacaspis pentagona*)、桑绵蜡蚧

(*Pulvinaria kuwacola*)、绿盲蝽(*Apolygus lucorum*)、Togo hemipterus、橘二叉蚜(*Toxoptera aurantii*)、*Saccharicoccus sacchari*、蔗根蚜(*Geoica lucifuga*)、瓶额飞虱(*Numata muiri*)、圣琼斯康盾蚧(*Comstockaspis pernicioso*)、矢尖蚧(*Unaspis citri*)、茄无网长管蚜(*Aulacorthum solani*)、广二星蝽(*Eysarcoris ventralis*)、银叶粉虱(*Bemisia argentifolii*)、大白叶蝉(*Cicadella spectra*)、春藤圆盾蚧(*Aspidiotus hederae*)、栗缘蝽(*Liorhyssus hyalinus*)、*Calophya nigridorsalis*、白背飞虱(*Sogatella furcifera*)、*Megoura crassicauda*、甘蓝蚜(*Brevicoryne brassicae*)、大豆蚜(*Aphis glycines*)、稻斑腹蛛缘蝽(*Leptocorisa oratorius*)、二点黑尾叶蝉(*Nephotettix virescens*)、莴苣指管蚜(*Uroeucon formosanum*)、烟盲蝽(*Cyrtopeltis tenuis*)、烟粉虱(*Bemisia tabaci*)、桃蜡蚧(*Lecanium persicae*)、*Parlatoria theae*、牡丹网盾蚧(*Pseudonidia paeoniae*)、茶小绿叶蝉(*Empoasca onukii*)、小珀椿象(*Plautia stali*)、百合西圆尾蚜(*Dysaphis tulipae*)、马铃薯长管蚜(*Macrosiphum euphorbiae*)、杜鹃军配虫(*Stephanitis pyrioides*)、角蜡蚧(*Ceroplastes ceriferus*)、*Parlatoria camelliae*、斯氏后丽盲蝽(*Apolygus spinolai*)、黑尾叶蝉(*Nephotettix cincticeps*)、青蝽(*Glaucias subpunctatus*)、杂毛合垫盲蝽(*Orthotylus flavosparsus*)、玉米蚜(*Rhopalosiphum maidis*)、玉米蜡蝉(*Peregrinus maidis*)、尖角二星蝽(*Eysarcoris parvus*)、温带臭虫(*Cimex lectularius*)、冷杉木虱(*Psylla abietis*)、褐飞虱(*Nilaparvata lugens*)、*Psylla tobirae*、*Eurydema rugosum*、梨二叉蚜(*Schizaphis piricola*)、*Psylla pyricola*、梨星片盾蚧(*Parlatoreopsis pyri*)、梨冠网蝽(*Stephanitis nashi*)、紫藤灰粉蚧(*Dysmicoccus wistariae*)、*Lepholeucaspis japonica*、梨扎圆尾蚜(*Sappaphis piri*)、萝卜蚜(*Lipaphis erysimi*)、台湾韭蚜(*Neotoxoptera formosana*)、莲缢管蚜(*Rhopalosiphum nymphaeae*)、蔷薇小叶蝉(*Edwardsianarosae*)、苏铁褐点盾蚧(*Pinnaspis aspidistrae*)、赤杨木虱(*Psylla alni*)、*Speusotettix subfuscus*、*Alnetoidia alneti*、稗飞虱(*Sogatella panicicola*)、苜蓿盲蝽(*Adelphocoris lineolatus*)、联斑棉红蝽(*Dysdercus poecilus*)、黑片盾蚧(*Parlatoria ziziphi*)、褐色肩网蝽(*Uhlerites debile*)、灰飞虱(*Laodelphax striatellus*)、六斑菜蝽(*Eurydema pulchrum*)、长肩棘缘蝽(*Cletus trigonus*)、*Clovina punctata*、*Empoasca* sp.、米兰褐软蚧(*Coccus hesperidum*)、莎草鼓胸长蝽(*Pachybrachius luridus*)、日本臀纹粉蚧(*Planococcus kraunhiae*)、*Stenotus binotatus*、葡萄阿小叶蝉(*Arboridia apicalis*)、*Macrosteles fascifrons*、*Dolycoris baccarum*、三环苜蓿盲蝽(*Adelphocoris triannulatus*)、葡萄根瘤蚜(*Viteus vitifolii*)、瘤缘椿象(*Acanthocoris sordidus*)、大稻缘蝽(*Leptocorisa acuta*)、瘤腹巨股长蝽(*Macropes obnubilus*)、稻棘缘蝽(*Cletus punctiger*)、点蜂缘椿象(*Riptortus clavatus*)、*Paratrioza cockerelli*、柳尖胸沫蝉(*Aphrophora costalis*)、*Lygus disponi*、东亚草盲蝽(*Lygus saundersi*)、松白粉蚧(*Crisicoccus pini*)、松小叶蝉(*Empoasca abietis*)、*Crisicoccus matsumotoi*、豆蚜(*Aphis craccivora*)、臭蝽(*Megacopta punctatissima*)、圆白星椿象(*Eysarcoris guttiger*)、*Lepidosaphes beckii*、柑橘木虱(*Diaphorina citri*)、*Toxoptera citricidus*、桔臀纹粉蚧(*Planococcus citri*)、柑桔裸粉虱(*Dialeurodes citri*)、茶树黑刺粉虱(*Aleurocanthus spiniferus*)、柑

橘小粉蚧 (*Pseudococcus citriculus*)、*Zyginella citri*、桔绵蜡蚧 (*Pulvinaria citricola*)、柑桔介壳虫 (*Coccusdiscrepans*)、茶树蛇眼蚧 (*Pseudaonidia duplex*)、柑橘绵蚧 (*Pulvinaria aurantii*)、*Lecanium corni*、稻绿蝽 (*Nezara viridula*)、刺狭盲蝽 (*Stenodema calcaratum*)、禾谷缢管蚜 (*Rhopalosiphum padi*)、*Sitobion akebiae*、麦二叉蚜 (*Schizaphis graminum*)、*Sorhoanus tritici*、李圆尾蚜 (*Brachycaudus helichrysi*)、紫翅果蝽 (*Carpocoris purpureipennis*)、桃蚜 (*Myzus persicae*)、桃大尾蚜 (*Hyalopterus pruni*)、柳蚜 (*Aphis farinose yanagicola*)、杨柳网蝽 (*Metasalis populi*)、矢尖蚧 (*Unaspis yanonensis*)、黄槿木虱 (*Mesohomotoma camphorae*)、*Aphis spiraecola*、苹果黄蚜 (*Aphis pomi*)、榆蛎盾蚧 (*Lepidosaphes ulmi*)、苹木虱 (*Psylla mali*)、*Heterocordylus flavipes*、苹果瘤蚜 (*Myzus malisuctus*)、*Aphidonuguis mali*、*Orientus ishidai*、*Ovatus malicolens*、苹果绵蚜 (*Eriosoma lanigerum*)、红蜡蚧 (*Ceroplastes rubens*) 和棉蚜 (*Aphis gossypii*) 等。

[0318] 作为鞘翅目 (*Coleoptera*) 害虫, 例如可举出: 合欢双条天牛 (*Xystrocera globosa*)、青翅蚁形隐翅虫 (*Paederus fuscipes*)、金边青花金龟 (*Eucetonia roelofsi*)、绿豆象 (*Callosobruchus chinensis*)、甘薯小象虫 (*Cylas formicarius*)、苜蓿叶象甲 (*Hypera postica*)、稻鳞象甲 (*Echinocnemus squameus*)、水稻负泥虫 (*Oulema oryzae*)、荷花叶甲 (*Donacia provosti*)、稻水象甲 (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、甘薯叶甲 (*Colasposoma dauricum*)、西印度甘薯象甲 (*Euscepes postfasciatus*)、墨西哥豆瓢虫 (*Epilachna varivestis*)、菜豆象 (*Acanthoscelides obtectus*)、玉米根萤叶甲 (*Diabrotica virgifera virgifera*)、李虎象 (*Involvulus cupreus*)、黄守瓜 (*Aulacophora femoralis*)、豌豆象 (*Bruchus pisorum*)、马铃薯瓢虫 (*Epilachnavigintioctomaculata*)、脊胸露尾甲 (*Carpophilus dimidiatus*)、甜菜大龟甲 (*Cassida nebulosa*)、粗背寡毛跳甲 (*Luperomorpha tenebrosa*)、黄曲条菜跳甲 (*Phyllotreta striolata*)、桑树黄星天牛 (*Psacothoe hilaris*)、黄斑天牛 (*Aeolesthes chrysothrix*)、*Curculio sikkimensis*、酱曲露尾甲 (*Carpophilus hemipterus*)、小青花金龟 (*Oxyetonia jucunda*)、根萤叶甲类 (*Diabrotica* spp.)、墨绿彩丽金龟 (*Mimelasplendens*)、玉米象 (*Sitophilus zeamais*)、赤拟谷盗 (*Tribolium castaneum*)、米象 (*Sitophilus oryzae*)、亚扁粉盗 (*Palorus subdepressus*)、*Melolontha japonica*、星天牛 (*Anoplophora malasiaca*)、大点拟粉虫 (*Neatus picipes*)、马铃薯甲虫 (*Leptinotarsa decemlineata*)、十一星叶甲食根亚种 (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、结缕草象甲 (*Sphenophorus venatus*)、十四点负泥虫 (*Crioceris quatuordecimpunctata*)、梅球颈象 (*Conotrachelus nenuphar*)、*Ceuthorrhynchidius albosuturalis*、小猿叶虫 (*Phaedon brassicae*)、烟草甲 (*Lasioderma serricorne*)、*Sitona japonicus*、葡萄丽金龟 (*Adoretus tenuimaculatus*)、黄粉虫 (*Tenebrio molitor*)、*Basilepta balyi*、*Hypera nigrirostris*、甜菜跳甲 (*Chaetocnema concinna*)、古铜异丽金龟 (*Anomala cuprea*)、*Heptophylla picea*、茄二十八星瓢虫 (*Epilachna vigintioctopunctata*)、长角叶甲 (*Diabrotica longicornis*)、*Eucetonia pilifera*、叩甲类 (*Agriotes* spp.)、黑毛皮蠹 (*Attagenus unicolor japonicus*)、斑鞘豆叶甲 (*Pagria signata*)、红铜丽金龟 (*Anomala rufocuprea*)、姬帕谷甲 (*Palorus ratzeburgii*)、褐菌虫 (*Alphitobius laevigatus*)、小圆

皮蠹 (*Anthrenus verbasci*)、褐粉蠹 (*Lyctus brunneus*)、杂拟谷盗 (*Tribolium confusum*)、*Medythia nigrobilineata*、葡萄虎天牛 (*Xylotrechus pyrrhoderus*)、黄瓜跳甲 (*Epitrix cucumeris*)、纵坑切梢小蠹 (*Tomicus piniperda*)、松墨天牛 (*Monochamus alternatus*)、日本豆金龟 (*Popillia japonica*)、豆芫青 (*Epicauta gorhami*)、玉米象 (*Sitophilus zeamais*)、桃实象甲 (*Rhynchites heros*)、蔬菜叶象甲 (*Listroderes costirostris*)、四纹豆象 (*Callosobruchus maculatus*)、*Phyllobius armatus*、梨花象 (*Anthonomus pomorum*)、铜绿里叶甲 (*Linnaeidea aenea*) 和墨西哥棉铃象 (*Anthonomus grandis*) 等。

[0319] 作为双翅目 (*Diptera*) 害虫,例如可举出:淡色库蚊 (*Culex pipiens pallens*)、甜菜潜叶蝇 (*Pegomya hyoscyami*)、莴苣南美斑潜蝇 (*Liriomyza huidobrensis*)、家蝇 (*Musca domestica*)、稻黄潜蝇 (*Chlorops oryzae*)、稻茎毛眼水蝇 (*Hydrellia sasakii*)、苜蓿斑潜蝇 (*Agromyza oryzae*)、小灰毛眼水蝇 (*Hydrellia griseola*)、菜豆蛇潜蝇 (*Ophiomyia phaseoli*)、瓜实蝇 (*Dacus cucurbitae*)、斑翅果蝇 (*Drosophila suzukii*)、本樱桃实蝇 (*Rhacochlaena japonica*)、厩腐蝇 (*Muscina stabulans*)、东亚异蚤蝇 (*Megaselia spiracularis*) 等蚤蝇类、毛蠓 (*Clogmia albipunctata*)、稻大蚊 (*Tipula aino*)、黑花蝇 (*Phormia regina*)、三带喙库蚊 (*Culex tritaeniorhynchus*)、中华按蚊 (*Anopheles sinensis*)、*Hylemya brassicae*、椒干瘿蚊 (*Asphondylia* sp.)、灰地种蝇 (*Delia platura*)、葱地种蝇 (*Delia antiqua*)、樱桃实蝇 (*Rhagoletis cerasi*)、地下家蚊 (*Culex pipiens molestus* Forskal)、地中海实蝇 (*Ceratitis capitata*)、*Bradysia agrestis*、肖藜泉蝇 (*Pegomya cunicularia*)、美洲斑潜蝇 (*Liriomyza sativae*)、番茄斑潜蝇 (*Liriomyza bryoniae*)、豌豆彩潜蝇 (*Chromatomyia horticola*)、葱斑潜蝇 (*Liriomyza chinensis*)、致倦库蚊 (*Culex quinquefasciatus*)、埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*)、白纹伊蚊 (*Aedes albopictus*)、三叶斑潜蝇 (*Liriomyza trifolii*)、美洲斑潜蝇 (*Liriomyza sativae*)、桔小实蝇 (*Dacus dorsalis*)、蜜柑大实蝇 (*Dacus tsuneonis*)、麦红吸浆虫 (*Sitodiplosis mosellana*)、*Meromyza nigriventris*、按实蝇 (*Anastrepha ludens*) 和苹果实蝇 (*Rhagoletis pomonella*) 等。

[0320] 作为膜翅目 (*Hymenoptera*) 害虫,例如可举出:短刺棱胸切叶蚁 (*Pristomyrmex pungens*)、肿腿蜂科类、法老蚁 (*Monomorium pharaonis*)、宽结大头蚁 (*Pheidole noda*)、芫菁叶蜂 (*Athalia rosae*)、栗瘿蜂 (*Dryocosmus kuriphilus*)、日本黑褐蚁 (*Formica fusca japonica*)、胡蜂类、*Athalia infumata infumata*、月季三节叶蜂 (*Arge pagana*)、日本菜叶蜂 (*Athalia japonica*)、*Acromyrmex* spp.、红火蚁 (*Solenopsis* spp.)、苹果三节叶蜂 (*Arge mali*) 和无毛凹臭蚁 (*Ochetellus glaber*) 等。

[0321] 作为直翅目 (*Orthoptera*) 害虫,例如可举出:南方稻草螽 (*Homorocoryphus lineosus*)、蝼蛄属 (*Gryllotalpa* sp.)、*Oxya hyla intricata*、小翅稻蝗 (*Oxya yezoensis*)、东亚飞蝗 (*Locusta migratoria*)、日本稻蝗 (*Oxya japonica*)、*Homorocoryphus jezoensis* 和 黄脸油葫芦 (*Teleogryllus emma*) 等。

[0322] 作为缨翅目害虫,例如可举出:红带滑胸针蓟马 (*Selenothrips rubrocinctus*)、稻蓟马 (*Stenchaetothrips biformis*)、稻管蓟马 (*Haplothrips aculeatus*)、*Ponticulothrips diospyrosi*、亮蓟马 (*Thrips flavus*)、玉米黄呆蓟马 (*Anaphothrips*

obscurus)、樟管滑蓟马(*Liothrips floridensis*)、唐菖蒲筒蓟马(*Thrips simplex*)、黑毛蓟马(*Thrips nigropilosus*)、温室蓟马(*Heliothrips haemorrhoidalis*)、桑伪棍蓟马(*Pseudodendrothrips mori*)、腹小头蓟马(*Microcephalothrips abdominalis*)、帕氏毛管蓟马(*Leeuwenia pasanii*)、*Litotetothrips pasaniae*、柑橘蓟马(*Scirtothrips citri*)、中华筒管蓟马(*Haplothrips chinensis*)、豆喙蓟马(*Mycterothripsglycines*)、*Thrips setosus*、茶黄硬蓟马(*Scirtothrips dorsalis*)、茶棍蓟马(*Dendrothrips minowai*)、*Haplothrips niger*、烟蓟马(*Thrips tabaci*)、葱韭蓟马(*Thripsalliorum*)、黄胸蓟马(*Thrips hawaiiensis*)、豆筒管蓟马(*Haplothrips kurdjumovi*)、袖指蓟马(*Chirothrips manicatus*)、花蓟马(*Frankliniella intonsa*)、色蓟马(*Thrips coloratus*)、西花蓟马(*Frankliniella occidentalis*)、棕榈蓟马(*Thrips palmi*)、百合蓟马(*Frankliniella lilivora*)和百合滑管蓟马(*Liothrips vaneeckei*)等。

[0323] 作为蜱螨目害虫,例如可举出:红纤沙螨(*Leptotrombidium akamushi*)、卢氏叶螨(*Tetranychus ludeni*)、变异革蜱(*Dermacentor variabilis*)、截形叶螨(*Tetranychus truncatus*)、柏氏禽刺螨(*Ornithonyssus bacoti*)、犬脂螨(*Demodex canis*)、山楂叶螨(*Tetranychus viennensis*)、神泽叶螨(*Tetranychus kanzawai*)、血红扇头蜱(*Rhipicephalus sanguineus*)等的真蜱类、马六甲肉食螨(*Cheyletusmalaccensis*)、腐食酪螨(*Tyrophagus putrescentiae*)、粉尘螨(*Dermatophagoidesfarinae*)、赤背蜘蛛(*Latrodectus hasseltii*)、台湾革蜱(*Dermacentor taiwanicus*)、*Acaphylla theavagrans*、侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonemus latus*)、番茄刺皮瘿螨(*Aculops lycopersici*)、林禽刺螨(*Ornithonyssus sylvairum*)、二斑叶螨(*Tetranychus urticae*)、*Eriophyes chibaensis*、人疥螨(*Sarcoptes scabiei*)、长角血蜱(*Haemaphysalis longicornis*)、肩突硬蜱(*Ixodes scapularis*)、似食酪螨(*Tyrophagus similis*)、普通肉食螨(*Cheyletus eruditus*)、柑桔全爪螨(*Panonychus citri*)、*Cheyletus moorei*、紫红短须螨(*Brevipalpus phoenicis*)、犬猫耳螨(*Octodectes cynotis*)、屋尘螨(*Dermatophagoides pteronyssinus*)、褐黄血蜱(*Haemaphysalis flava*)、卵形硬蜱(*Ixodes ovatus*)、*Phyllocoptura citri*、*Aculus schlechtendali*、苹果全爪螨(*Panonychus ulmi*)、美洲钝眼蜱(*Amblyomma americanum*)和鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*)、*Rhyzoglyphus robini*、*Sancassania* sp.等。

[0324] 作为等翅目害虫,例如可举出:*Reticulitermes miyatakei*、小楹白蚁(*Incisitermes minor*)、台湾乳白蚁(*Coptotermes formosanus*)、*Hodotermopsis japonica*、散白蚁(*Reticulitermes* sp.)、黄胸散白蚁(*Reticulitermes flaviceps amamianus*)、古希美树白蚁(*Glyptotermes kushimensis*)、广州乳白蚁(*Coptotermes guangzhouensis*)、恒春新白蚁(*Neotermes koshunensis*)、*Glyptotermes kodamai*、赤树白蚁(*Glyptotermes satsumensis*)、截头堆砂白蚁(*Cryptotermes domesticus*)、黑翅土白蚁(*Odontotermes formosanus*)、*Glyptotermes nakajimai*、新渡户近扭白蚁(*Pericapritermes nitobei*)和栖北散白蚁(*Reticulitermes speratus*)等。

[0325] 作为蜚蠊目害虫,例如可举出:黑胸大蠊(*Periplaneta fuliginosa*)、德国小蠊(*Blattella germanica*)、东方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、褐斑大蠊(*Periplaneta brunnea*)、拟德国小蠊(*Blattella lituricollis*)、日本大蠊(*Periplaneta japonica*)和

美洲大蠊(*Periplaneta americana*)等。

[0326] 作为蚤目,例如可举出:人蚤(*Pulex irritans*)、猫蚤(*Ctenocephalides felis*)和鸡角叶蚤(*Ceratophyllus gallinae*)等。

[0327] 作为线虫类,例如可举出:草莓芽线虫(*Nothotylenchus acris*)、水稻干尖线虫(*Aphelenchoides besseyi*)、穿刺短体线虫(*Pratylenchus penetrans*)、北方根结线虫(*Meloidogyne hapla*)、南方根结线虫(*Meloidogyne incognita*)、马铃薯金线虫(*Globodera rostochiensis*)、爪哇根结线虫(*Meloidogyne javanica*)、大豆胞囊线虫(*Heterodera glycines*)、咖啡短体线虫(*Pratylenchus coffeae*)、落选短体线虫(*Pratylenchus neglectus*)和柑桔根线虫(*Tylenchus semipenetrans*)等。

[0328] 作为软体动物类,例如可举出:福寿螺(*Pomacea canaliculata*)、非洲大蜗牛(*Achatina fulica*)、双线蛞蝓(*Meghimatium bilineatum*)、*Lehmannina valentiana*、黄蛞蝓(*Limax flavus*)和*Acusta despecta sieboldiana*等。

[0329] 此外,本发明的用于农业园艺的杀虫剂对作为其它害虫的番茄潜麦蛾(*Tuta absoluta*)具有较强的杀虫效果。

[0330] 此外,作为防治对象之一的动物寄生性的蜱螨,例如可举出:微小牛蜱(*Boophilus microplus*)、血红扇头蜱(*Rhipicephalus sanguineus*)、长角血蜱(*Haemaphysalis longicornis*)、褐黄血蜱(*Haemaphysalis flava*)、何氏血蜱(*Haemaphysalis campanulata*)、嗜群血蜱(*Haemaphysalis concinna*)、日本血蜱(*Haemaphysalis japonica*)、北岗血蜱(*Haemaphysalis kitaokai*)、*Haemaphysalis ias*、卵形硬蜱(*Ixodes ovatus*)、*Ixodes nipponensis*、全沟硬蜱(*Ixodes persulcatus*)、龟甲形钝眼蜱(*Amblyomma testudinarium*)、*Haemaphysalis megaspinosa*、网纹革蜱(*Dermacentor reticulatus*)和台湾革蜱(*Dermacentor taiwanesis*)这样的蜱类;鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*)、北方刺脂螨(*Ornithonyssus sylviarum*)和囊禽刺螨(*Ornithonyssus bursa*)这样的林禽刺螨类(Northernfowl mite);危鸡犹沙螨(*Eutrombicula wichmanni*)、红纤恙螨(*Leptotrombidium akamushi*)、苍白纤恙螨(*Leptotrombidium pallidum*)、富士纤恙螨(*Leptotrombidium fuji*)、*Leptotrombidium tosa*、秋收恙螨(*Neotrombicula autumnalis*)、阿[耳弗雷杜热斯]氏真恙螨(*Eutrombicula alfreddugesi*)和宫川合轮螨(*Helenicula miyagawai*)这样的恙螨类;牙氏姬螯螨(*Cheyletiella yasguri*)、兔皮姬螯螨(*Cheyletiella parasitivorax*)和布氏姬螯螨(*Cheyletiella blakei*)这样的姬螯螨类;兔痒螨(*Psoroptes cuniculi*)、牛足螨(*Chorioptes bovis*)、猫犬耳螨(*Otodectes cynotis*)、人疥螨(*Sarcoptes scabiei*)和猫背肛螨(*Notoedres cati*)这样的疥螨类;以及犬脂螨(*Demodex canis*)这样的毛囊脂螨类等。

[0331] 作为其他防治对象的蚤,例如可举出属于蚤目(*Siphonaptera*)的外部寄生性无翅昆虫,更具体而言,可举出属于蚤科(*Pulicidae*)和欧洲鼠蚤科(*Ceratophyllus*)等的蚤类。作为属于蚤科的蚤类,例如可举出:犬栉首蚤(*Ctenocephalides canis*)、猫蚤(*Ctenocephalides felis*)、人蚤(*Pulex irritans*)、鸡蚤(*Echidnophaga gallinacea*)、印鼠客蚤(*Xenopsylla cheopis*)、缓慢细蚤(*Leptopsylla segnis*)、具带病蚤(*Nosopsyllus fasciatus*)和不等单蚤(*Monopsyllus anisus*)等。

[0332] 此外,作为其他防治对象的外部寄生生物,例如可举出:牛盲虱(*Haematopinus*

eurysternus)、马吸血虱(*Haematopinus asini*)、羊虱(*Dalmalinia ovis*)、长鼻牛虱(*Linognathus vituli*)、猪血虱(*Haematopinus suis*)、阴虱(*Phthirus pubis*)和头虱(*Pediculus capitis*)这样的吸虱类;以及犬啮毛虱(*Trichodectes canis*)这样的咬虱类、三角虻(*Tabanus trigonus*)、虚库蠓(*Culicoides schultzei*)和饰蚋(*Simulium ornatum*)这样的吸血性双翅目害虫等。此外,作为内部寄生生物,例如可举出:肺虫、鞭虫(*Trichuris*)、结节线虫、胃内寄生虫、蛔虫和丝虫类这样的线虫类;刺猬绦虫(*Spirometra erinaceieuropaei*)、阔节裂头绦虫(*Diphyllobothrium latum*)、复孔绦虫(*Dipylidium caninum*)、多头绦虫(*Taenia multiceps*)、细粒棘球绦虫(*Echinococcus granulosus*)和多房棘球绦虫(*Echinococcus multilocularis*)这样的绦虫类;日本血吸虫(*Schistosoma japonicum*)和片吸虫(*Fasciola hepatica*)这样的吸虫类;以及球虫、疟原虫(*Plasmodium malariae*)、肠内肉孢子虫、弓形虫、隐孢子虫这样的原生动物等。

[0333] 由于以本发明的通式(1)表示的化合物或其盐类为有效成分的农艺园艺用杀虫剂,对损害水田作物、旱田作物、果树、蔬菜、其它作物和花卉等的所述害虫具有显著的防治效果,因此根据预测发生害虫的时期来在发生害虫前或确认发生的时间点对育苗设施、水田、旱田、果树、蔬菜、其它作物、花卉等的种子、水田水、茎叶或土壤等的栽培载体等进行处理,来实现本发明的农艺园艺用杀虫剂的期望效果。其中,优选的使用方式是:通过对作物、花卉等的育苗土壤、移植时的种植孔土壤、植物的根、灌溉水、水耕栽培中的栽培水等进行处理、经过土壤或不经过土壤而由根吸收本发明化合物而利用了所谓的渗透转移性。

[0334] 可使用本发明的农艺园艺用杀虫剂的有用植物没有特别限定,例如可举出:谷类(例如,稻子、大麦、小麦、黑麦、燕麦、玉米等)、豆类(大豆、红豆、蚕豆、豌豆、菜豆、花生等)、果树・果实类(苹果、柑橘类、梨、葡萄、桃子、李子、樱桃、胡桃、栗子、杏仁、香蕉等)、叶・果菜类(卷心菜、番茄、菠菜、西兰花、生菜、洋葱、葱(胡葱、冬葱)、甜椒、茄子、草莓、胡椒、秋葵、韭菜等)、根茎类蔬菜(胡萝卜、马铃薯、甘薯、芋头、萝卜、芜菁、藕、牛蒡、大蒜、薤等)、加工用作物(棉、麻、甜菜根、啤酒花、甘蔗、甜菜、橄榄、橡胶、咖啡、烟草、茶等)、瓜类(南瓜、黄瓜、西瓜、真桑瓜、甜瓜等)、牧草类(鸭茅、高粱、梯牧草、三叶草、紫花苜蓿等)、结缕草类(高丽结缕草、糠穗草(*Agrostis*)等)、香料等观赏用作物(薰衣草、迷迭香、百里香、荷兰芹、胡椒、生姜等)、花卉类(菊花、玫瑰、康乃馨、兰花、郁金香、百合等)、庭园树木(银杏、樱花类、珊瑚木等)、林木(冷杉类、鱼鳞云杉类、松类、柏、杉、日本扁柏、桉等)等植物。

[0335] 所述“植物”还包含通过对除草剂具有抗性的经典育种法或基因重组技术而被赋予了抗性的植物,所述除草剂包含:异噁唑草酮等HPPD抑制剂、咪草烟、噻吩磺隆等ALS抑制剂、草甘膦等EPSP合成酶抑制剂、草铵膦等谷氨酰胺合成酶抑制剂、烯禾啶等乙酰辅酶A羧化酶抑制剂、溴苯腈、麦草畏、2,4-D等。

[0336] 作为通过经典育种法被赋予了抗性的“植物”的实例,可举出对咪草烟等咪唑啉酮类ALS抑制型除草剂具有抗性的油菜籽、小麦、向日葵、水稻,并已经以Clearfield(注册商标)的商品名贩售。可举出同样通过经典育种法而对噻吩磺隆等磺酰脲类ALS抑制型除草剂具有抗性的大豆,已经以STS大豆的商品名贩售。作为同样通过经典育种法赋予了对三酮肟(*Trion oxime*)类、芳氧基苯氧基丙酸类除草剂等乙酰辅酶A羧化酶抑制剂的抗性的植物的实例,可举出SR玉米(Cone)等。

[0337] 此外,被赋予了对乙酰辅酶A羧化酶抑制剂的抗性的植物记载于美利坚合众国国

家科学院院刊(Proceedings of the National Academy of Sciences of the United States of America, Proc. Natl. Acad. Sci. USA) 87卷, 7175~7179页(1990年)等。此外, 对乙酰辅酶A羧化酶抑制剂具有抗性的变异乙酰辅酶A羧化酶已经报告于杂草科学(Weed Science) 53卷, 728~746页(2005年)等, 可通过基因重组技术将这样的变异乙酰辅酶A羧化酶基因导入植物, 或通过将与抗性赋予有关的变异导入植物乙酰辅酶A羧化酶, 来得到对乙酰辅酶A羧化酶抑制剂具有抗性的植物, 并且, 通过以嵌合修复技术(chimeraplasty technology) (Gura T. 1999. Repairing the Genome's Spelling Mistakes. Science 285: 316-318.) 为代表的将导入有碱基取代变异的核酸导入植物细胞内从而在植物的乙酰辅酶A羧化酶基因、ALS基因等中部位特异性地导入氨基酸取代变异的技术, 而能够得到对乙酰辅酶A羧化酶抑制剂、ALS抑制剂等具有抗性的植物, 对于这些植物也可使用本发明的农艺园艺用杀虫剂。

[0338] 此外, 作为基因重组植物中表达的毒素, 可举出: 源自蜡样芽孢杆菌、日本甲虫芽孢杆菌的杀虫蛋白; 源自苏云金芽孢杆菌的Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C等 δ -内毒素、VIP1、VIP2、VIP3或VIP3A等杀虫蛋白; 源自线虫的杀虫蛋白; 蝎子毒素、蜘蛛毒素、蜂毒素或昆虫特异性神经毒素等由动物产生的毒素; 丝状菌类毒素; 植物凝集素; 凝集素; 胰凝乳蛋白酶抑制剂、丝氨酸蛋白酶抑制剂、马铃薯块茎储藏蛋白(Patatin)、半胱氨酸蛋白酶抑制剂、木瓜蛋白酶抑制剂等蛋白酶抑制剂; 蓖麻毒素、玉米-RIP、红豆碱、绛酚(Rufin)、肥皂草素、泻根(Bryonia dioica)等核糖体失活蛋白(RIP); 3-羟基类固醇氧化酶、蜕化类固醇-UDP-葡萄糖基转移酶、胆固醇氧化酶等类固醇代谢酶; 蜕皮激素抑制剂; HMG-CoA还原酶; 钠通道、钙通道抑制剂等离子通道抑制剂; 保幼激素酯酶; 利尿激素受体; 芪合酶(Stilbene synthase); 联苄合酶; 几丁质酶; 葡聚糖酶等。

[0339] 此外, 作为这样的基因重组植物中表达的毒素, 还包含: Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1、Cry9C、Cry34Ab或Cry35Ab等 δ -内毒素蛋白、VIP1、VIP2、VIP3或VIP3A等杀虫蛋白的混合毒素、部分缺失的毒素、经过修饰的毒素。使用重组技术, 通过这些蛋白的不同的域的新组合来产生混合毒素。作为部分缺失的毒素, 已知有氨基酸序列的一部分缺失的Cry1Ab。作为经过修饰的毒素, 天然型毒素的一个或多个氨基酸被替换。

[0340] 这些毒素的实例和能够合成这些毒素的重组植物记载于EP-A-0374753、W093/07278、W095/34656、EP-A-0427529、EP-A-451878、W003/052073等。

[0341] 这些重组植物中包含的毒素特别是赋予了植物对甲虫目害虫、半翅目害虫、双翅目害虫、鳞翅目害虫、线虫类的抗性。本发明的农艺园艺用杀虫剂可与这些技术组合使用或系统性地使用。

[0342] 为了防治各种害虫, 将有效防治害虫或线虫的量的本发明的农艺园艺用杀虫剂直接施用或用水等适宜稀释或以悬浮形式用于预测发生该害虫和线虫的植物即可, 例如针对果树、谷类、蔬菜等中发生的害虫和线虫, 除了散布于茎叶部之外, 还可将种子浸渍于药剂中、对种子进行粉衣(Seed coat)、进行过氧化钙处理等种子处理、土壤全层混合、条施、床土混合、穴盘苗处理、种植孔处理、根系处理、施顶肥、水稻的箱处理、水面施用等对土壤等进行处理而能够由根吸收, 来使用本发明的农艺园艺用杀虫剂。此外, 还可通过在营养液(水耕)栽培中向营养液中施用、烟熏或注入树干等来使用。

[0343] 此外, 将有效防治害虫的量的本发明的农艺园艺用杀虫剂直接或用水等适宜稀释

或以悬浮形式用于预测发生该害虫的场所即可,例如除了散布于储粮害虫、房屋害虫、卫生害虫、森林害虫等之外,还可用作对房屋建材的涂布、烟熏、诱饵等。

[0344] 作为种子处理的方法,例如可举出:将液态或固体状的制剂以稀释或未稀释的液体状态浸渍种子以使药剂渗透的方法;将固体制剂或液态制剂与种子混合并进行粉衣处理以附着于种子的表面的方法;与树脂、聚合物等附着性的载体混合来包覆种子的方法;在种植的同时散布于种子附近的方法等。

[0345] 进行该种子处理的“种子”是指植物的繁殖中使用的栽培初期的植物体,例如除种子之外,还可举出:球根、块茎、种薯、植物芽、珠芽、鳞茎或插枝栽培用的营养繁殖用的植物体。

[0346] 在实施本发明的使用方法的情况下植物的“土壤”或“栽培载体”是表示用于栽培作物的支撑体,特别是表示使根生长的支撑体,材质没有特别限定,是植物可生长的材质即可,可以是所谓的土壤、育苗垫、水等,作为具体的原材料,例如可以是沙子、轻石、蛭石、硅藻土、琼脂、凝胶状物质、高分子物质、岩棉、玻璃棉、木屑、树皮等。

[0347] 针对作物茎叶部或储粮害虫、房屋害虫、卫生害虫或森林害虫等散布的方法,可举出:将乳剂、悬浮剂等液体制剂或可湿性粉剂或颗粒状可湿性粉剂等固体制剂用水适宜稀释并散布的方法、将粉剂进行散布的方法或烟熏等。

[0348] 作为向土壤施用的方法,例如可举出:将液体制剂用水稀释或未稀释并施用于植物体的根或育苗用苗床等的方法、将粒剂散布至植物体的根或用于育苗的苗床等的方法、在播种前或移植前散布粉剂、可湿性粉剂、颗粒状可湿性粉剂、粒剂等并与整个土壤混合的方法、在播种前或种植植物体前将粉剂、可湿性粉剂、颗粒状可湿性粉剂、粒剂等散布于种植孔、作条等的方法等。

[0349] 作为将水稻施用于育苗箱的方法,剂型可根据例如播种时施用、绿化期施用、移植时施用等施用时期而不同,以粉剂、颗粒状可湿性粉剂、粒剂等剂型施用即可。可通过与栽培土混合来施用,可进行栽培土和粉剂、颗粒状可湿性粉剂或粒剂等的混合,例如进行床土混合、覆土混合、与整个栽培土的混合等。可以简单地将栽培土与各种制剂交替地形成层状来施用。

[0350] 作为施用于水田的方法,通常将大粒剂(Jumbo)、包装剂、粒剂、颗粒状可湿性粉剂等固体制剂、流动剂、乳剂等液体状制剂散布于水淹状态的水田。此外,可在插秧时,将适当的制剂直接或与肥料混合后散布并注入土壤中。此外,可通过在水口、灌溉装置等水田中的水的流入源处利用乳剂、流动剂等药液并伴随水的供给而省力地施用。

[0351] 在旱田作物中,可在播种至育苗期间,对种子或植物体附近的栽培载体等进行处理。在直接播种于旱田的植物中,除了直接对种子进行处理之外,优选对栽培中的植物的根进行处理。可使用粒剂进行散布处理或用水稀释或未稀释的药剂以液态进行灌溉处理。将粒剂与播种前的栽培载体混合后进行播种也是优选的处理。

[0352] 作为进行移植的栽培植物的播种、育苗期的处理,除了直接对种子进行处理之外,优选对育苗用苗床进行制成液态的药剂的灌溉处理或粒剂的散布处理。此外,在定植时用粒剂对种植孔进行处理或将粒剂与移植位置附近的栽培载体混合也是优选的处理。

[0353] 通常,根据农药制剂上的常规方法将本发明的农艺园艺用杀虫剂制成易于使用的形状来使用。

[0354] 即,就本发明的通式(1)表示的化合物或其盐类而言,使其溶解、分离、悬浮、混合、浸渍、吸附或附着于适当的不活泼载体或根据需要与辅助剂一起以适当的比例混合后再溶解、分离、悬浮、混合、浸渍、吸附或附着于适当的不活泼载体以制成适宜的剂型来使用即可,例如制成悬浮剂、乳剂、液剂、可湿性粉剂、颗粒状可湿性粉剂、粒剂、粉剂、片剂、包装剂等。

[0355] 本发明的组合物(农艺园艺用杀虫剂或动物寄生生物防治剂)中,除了有效成分之外,还可根据需要含有农药制剂或动物寄生生物防治剂中通常使用的添加成分。作为该添加成分,可举出:固体载体、液体载体等载体、表面活性剂、分散剂、湿润剂、粘合剂、增粘剂、增稠剂、着色剂、扩展剂、铺展剂、防冻剂、抗结块剂、崩解剂、分解抑制剂等。根据其它需要,可以将防腐剂、植物片等用作添加成分。这些添加成分可以单独使用一种并且可以组合使用两种以上。

[0356] 作为固体载体,例如可举出:石英、黏土、高岭石、叶蜡石、绢云母、滑石粉、膨润土、酸性白土、硅镁土、沸石、硅藻土等天然矿物类、碳酸钙、硫酸铵、硫酸钠、氯化钾等无机盐类、合成硅酸、合成硅酸盐、淀粉、纤维素、植物粉末(例如锯末、椰子壳、玉米秸秆、烟梗等)等有机固体载体、聚乙烯、聚丙烯、聚偏二氯乙烯等塑料载体、尿素、无机空心体、塑料空心体、气相法二氧化硅(fumed silica,白炭黑)等。这些可以单独使用一种并且可以组合使用两种以上。

[0357] 作为液体载体,例如可举出:甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇等一价醇类、乙二醇、二乙二醇、丙二醇、己二醇、聚乙二醇、聚丙二醇、丙三醇等多元醇类这样的醇类、丙二醇醚等多元醇化合物类、丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮、二异丁基酮、环己酮等酮类、乙醚、二噁烷、乙二醇单乙醚、二丙醚、THF等醚类、正构烷烃、环烷、异链烷烃、煤油、矿油等脂肪族烃类、苯、甲苯、二甲苯、溶剂石脑油、烷基萘等芳香族烃类、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等卤代烃类、乙酸乙酯、邻苯二甲酸二异丙酯、邻苯二甲酸二丁酯、邻苯二甲酸二辛酯、己二酸二甲酯等酯类、 γ -丁内酯等内酯类、二甲基甲酰胺、二乙基甲酰胺、二甲基乙酰胺、N-烷基吡咯烷酮等酰胺类、乙腈等腈类、二甲亚砷等硫化物类、大豆油、菜籽油、棉籽油、蓖麻油等植物油、水等。这些可以单独使用一种并且可以组合使用两种以上。

[0358] 作为用作分散剂、湿展剂的表面活性剂,例如可举出:山梨糖醇酐脂肪酸酯、聚氧乙烯山梨糖醇酐脂肪酸酯、蔗糖脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯树脂酸酯、聚氧乙烯脂肪酸二酯、聚氧乙烯烷基醚、聚氧乙烯烷基芳基醚、聚氧乙烯烷基苯基醚、聚氧乙烯二烷基苯基醚、聚氧乙烯烷基苯基醚福尔马林缩合物、聚氧乙烯聚氧丙烯嵌段共聚物、聚苯乙烯聚氧乙烯嵌段共聚物、烷基聚氧乙烯聚丙烯嵌段共聚物醚、聚氧乙烯烷基胺、聚氧乙烯脂肪酸酰胺、聚氧乙烯脂肪酸双苯基醚、聚亚烷基苄基苯基醚、聚氧亚烷基苯乙基苯基醚、乙炔二醇、聚氧亚烷基加成乙炔二醇、聚氧乙烯醚型聚硅氧烷、酯型聚硅氧烷、氟类表面活性剂、聚氧乙烯蓖麻油、聚氧乙烯固化蓖麻油等非离子性表面活性剂、烷基硫酸盐、聚氧乙烯烷基醚硫酸盐、聚氧乙烯烷基苯基醚硫酸盐、聚氧乙烯苯乙基苯基醚硫酸盐、烷基苯磺酸盐、烷基芳基磺酸盐、木质素磺酸盐、烷基磺基琥珀酸盐、萘磺酸盐、烷基萘磺酸盐、萘磺酸的福尔马林缩合物的盐、烷基萘磺酸的福尔马林缩合物的盐、脂肪酸盐、聚羧酸盐、聚丙烯酸盐、N-甲基-脂肪酸肌氨酸盐、树脂酸盐、聚氧乙烯烷基醚磷酸盐、聚氧乙烯烷基苯基醚磷酸盐等阴离子性表面活性剂、月桂基胺盐酸盐、硬脂基胺盐酸盐、油胺盐酸盐、硬脂胺乙

酸盐、硬脂基氨基丙基胺乙酸盐、烷基三甲基氯化铵、烷基二甲基苯扎氯铵等烷基胺盐等阳离子表面活性剂、氨基酸型或甜菜碱型等的两性表面活性剂等。这些表面活性剂可以单独使用一种并且可以组合使用两种以上。

[0359] 作为粘合剂、增粘剂,例如可举出:羧甲基纤维素及其盐、糊精、水溶性淀粉、黄原胶、瓜尔豆胶、蔗糖、聚乙烯吡咯烷酮、阿拉伯树胶、聚乙烯醇、聚乙酸乙烯酯、聚丙烯酸钠、平均分子量6000~20000的聚乙二醇、平均分子量10万~500万的聚环氧乙烷、磷脂(例如脑磷脂、卵磷脂等)纤维素粉末、糊精、加工淀粉、聚氨基酸螯合物、交联聚乙烯吡咯烷酮、马来酸与苯乙烯类形成的共聚物、(甲基)丙烯酸类共聚物、包含多元醇的聚合物与二羧酸酐形成的半酯、聚苯乙烯磺酸的水溶性盐、石蜡、萘烯、聚酰胺树脂、聚丙烯酸盐、聚氧乙烯、蜡、聚乙烯基烷基醚、烷基酚福尔马林缩合物、合成树脂乳液等。

[0360] 作为增稠剂,例如可举出:黄原胶、瓜尔豆胶、Diutan gum、羧甲基纤维素、聚乙烯吡咯烷酮、羧乙烯基聚合物、丙烯酸类聚合物、淀粉化合物、多糖类这样的水溶性高分子、高纯度膨润土、气相法二氧化硅(fumed silica、白炭黑)这样的无机微粉等。

[0361] 作为着色剂,例如可举出:氧化铁、氧化钛、普鲁士蓝这样的无机颜料、茜素染料、偶氮染料、金属酞菁染料这样的有机染料等。

[0362] 作为防冻剂,例如可举出:乙二醇、二乙二醇、丙二醇、丙三醇等多元醇类等。

[0363] 作为用于防止结块、促进崩解的辅助剂,例如可举出:淀粉、海藻酸、甘露糖、半乳糖等多糖类、聚乙烯吡咯烷酮、气相法二氧化硅(fumed silica、白炭黑)、酯胶、石油树脂、三聚磷酸钠、六偏磷酸钠、硬脂酸金属盐、纤维素粉末、糊精、甲基丙烯酸酯的共聚物、聚乙烯吡咯烷酮、聚氨基酸螯合物、磺化苯乙烯·异丁烯·马来酸酐共聚物、淀粉·聚丙烯腈接枝共聚物等。

[0364] 作为分解抑制剂,例如可举出:沸石、生石灰、氧化镁这样的干燥剂、酚化合物、胺化合物、硫化物、磷酸化合物等抗氧化剂、水杨酸化合物、二苯甲酮化合物等紫外线吸收剂等。

[0365] 作为防腐剂,例如可举出山梨酸钾、1,2-苯并噻唑啉-3-酮等。

[0366] 此外,还可根据需要使用功能性铺展剂、增效醚等代谢分解抑制剂等活性增强剂、丙二醇等防冻剂、BHT等抗氧化剂、紫外线吸收剂等其它辅助剂。

[0367] 有效成分化合物的混合比例可根据需要进行增减,在本发明的农艺园艺用杀虫剂100重量份中,从0.01~90重量份的范围内适宜选择并使用即可,例如,在粉剂、粒剂、乳剂或可湿性粉剂的情况下,0.01~50重量份(相对于农艺园艺用杀虫剂的总重量为0.01~50重量%)是适当的。

[0368] 本发明的农艺园艺用杀虫剂的使用量根据各种因素而变动,例如目的、目标害虫、作物的发育情况、害虫的发生倾向、天气、环境条件、剂型、施用方法、施用位置、施用时期等,作为有效成分化合物,根据目的从每10公亩0.001g~10kg,优选为0.01g~1kg的范围内适宜选择即可。

[0369] 为了扩大防治对象病虫害、延长最佳防治时间或降低药量,可将本发明的农艺园艺用杀虫剂与其他农艺园艺用杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、灭菌剂、生物农药等混合而进行使用,并且,还可根据使用情况与除草剂、植物生长调节剂、肥料等混合而进行使用。

[0370] 作为用于该目的的其他农业园艺用杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂,例如可举出:3,5-

二甲苯基甲基氨基甲酸酯(3,5-xylyl methylcarbamate,XMC)、仲丁威(fenobucarb,BPMC)、Bt毒素类杀虫性化合物、杀螨酯(chlorfenson,CPCBS)、二氯二异丙醚(dichlorodiisopropyl ether,DCIP)、1,3-二氯丙烯(1,3-Dichloropropene,D-D)、DDT、NAC、伐灭磷(0-4-dimethylsulfamoylphenyl 0,0-diethyl phosphorothioate,DSP)、苯硫磷(0-ethyl 0-4-nitrophenyl phenylphosphonothioate,EPN)、异氰尿酸三丙酯(tripropylisocyanurate,TPIC)、氟丙菊酯(acrinathrin)、印楝素(azadirachtin)、acynonapyr、保棉磷(azinhos-methyl)、灭螨醌(acequinocyl)、啉虫脒(acetamiprid)、乙酰虫脒(acetoprole)、乙酰甲胺磷(acephate)、阿巴美丁(abamectin)、双丙环虫酯(afidopyropen)、阿维菌素-B(ivermectin-B)、磺胺菊酯(amidoflumet)、双甲脒(amitraz)、棉铃威(alanycarb)、涕灭威(aldicarb)、涕灭砒威(aldoxycarb)、艾氏剂(aldrin)、 α -硫丹(alpha-endosulfan)、 α -氯氰菊酯(alpha-cypermethrin)、丙硫多菌灵(albendazole)、烯丙菊酯(allethrin)、氯唑磷(isazofos)、艾沙米多福(isamidofos)、异美沙同磷(isoamidofos)、噁唑磷(isoxathion)、isocycloseram、异柳磷(isofenphos)、异丙威(isoprocarb:MIPC)、 ϵ -甲氧苄氟菊酯(epsilon-metofluthrin)、epsilon-momfluorothrin、伊维菌素(ivermectin)、新烟磷(imicyafos)、吡虫啉(imidacloprid)、炔咪菊酯(imiprothrin)、吡唑虫酰胺(indazapyroxamet)、茚虫威(indoxacarb)、S-氰戊菊酯(esfenvalerate)、乙硫苯威(ethiofencarb)、乙硫磷(ethion)、乙虫脒(ethiprole)、乙螨唑(etoxazole)、醚菊酯(ethofenprox)、灭线磷(ethoprophos)、乙嘧硫磷(etrinfos)、埃玛菌素(emamectin)、埃玛菌素苯甲酸盐(emamectin-benzoate)、硫丹(endosulfan)、右旋烯炔菊酯(empenthrin)、oxazosulfonyl、杀线威(oxamyl)、亚砒磷(oxydemeton-methyl)、异亚砒磷(oxydeprofos:ESP)、奥苯达唑(oxibendazole)、奥芬达唑(oxfendazole)、油酸钾(Potassium oleate)、油酸钠(sodium oleate)、硫线磷(cadusafos)、kappa-bifenthrin、杀螟丹(cartap)、甲萘威(carbaryl)、丁硫克百威(carbosulfan)、克百威(carbofuran)、 γ -氯氟氰菊酯(gamma-cyhalothrin)、灭杀威(xylylcarb)、喹硫磷(quinalphos)、烯虫炔酯(kinoprene)、灭螨猛(chinomethionat)、除线威(cloethocarb)、噻虫胺(clothianidin)、四螨嗪(clofentezine)、环虫酰胺(chromafenozide)、氯虫苯甲酰胺(chlorantraniliprole)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、杀虫脒(chlordimeform)、氯丹(chlordane)、毒死蜱(chlorpyrifos)、甲基毒死蜱(chlorpyrifos-methyl)、溴虫脒(chlorphenapyr)、杀螨酯(chlorfenson)、毒虫畏(chlorfenvinphos)、氟啉脒(chlorfluazuron)、乙酯杀螨醇(chlorobenzilate)、氯苯甲酸酯(chlorobenzoate)、右旋反式氯炔丙菊酯(chloroprallethrin)、开乐散(三氯杀螨醇:dicofol)、水杨硫磷(salithion)、氯氟氰虫酰胺(cyhalodiamide)、杀螟脒(cyanophos:CYAP)、丁醚脒(diafenthiuron)、除线特(diamidafos)、溴氰虫酰胺(cyantraniliprole)、 θ -氯氰菊酯(theta-cypermethrin)、遍地克(dienochlor)、乙唑螨腈(cyetyprafen)、腈吡螨酯(cyenopyrafen)、蔬果磷(dioxabenzofos)、苯虫醚(diofenolan)、 σ -氯氰菊酯(sigma-cypermethrin)、环溴虫酰胺(cyclaniliprole)、除线磷(dichlofenthion:ECP)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、敌敌畏(dichlorvos:DDVP)、二氯噻吡嘧啶(dicloromezotiaz)、乙拌磷(disulfoton)、呋虫胺(dinotefuran)、氯氟氰虫酰胺(cyhalodiamide)、氯氟氰菊酯(cyhalothrin)、苯醚氰菊酯(cyphenothrin)、氟氯氰菊酯(cyfluthrin)、除虫脒

(diflubenzuron)、丁氟螨酯(cyflumetofen)、氟螨嗪(diflovidazin)、环丙氟虫胺(cyproflanilide)、三环锡(cyhexatin)、氯氰菊酯(cypermethrin)、甲基毒虫畏(dimethylvinphos)、乐果(dimethoate)、噻虫唑酰胺(dimpropyridaz)、四氟甲醚菊酯(dimefluthrin)、氟硅菊酯(silafluofen)、灭蝇胺(cyromazine)、spidoxamat、乙基多杀菌素(spinetoram)、多杀霉素(spinosad)、螺螨双酯(spirobudifen)、螺螨酯(spirodiclofen)、螺虫乙酯(spirotetramat)、甲氧吡啶乙酯(spiropidion)、螺甲螨酯(spiromesifen)、氟虫胺(sulfluramid)、硫丙磷(sulprofos)、氟啶虫胺脒(sulfoxaflor)、ζ-氯氰菊酯(zeta-cypermethrin)、二嗪磷(diazinon)、氟胺氰菊酯(tau-fluvalinate)、棉隆(dazomet)、噻虫啉(thiacloprid)、噻虫嗪(thiamethoxam)、tioazafen、硫双威(thiodicarb)、杀虫环(thiocyclam)、杀虫单(thiosultap)、杀虫双(thiosultap-sodium)、虫线磷(thionazin)、甲基乙拌磷(thiometon)、硫虫酰胺(tiorantraniliprole)、避蚊胺(deet)、狄氏剂(dieldrin)、四氯虫酰胺(Tetrachlorantraniliprole)、tyclopiazoflor、杀虫畏(tetrachlorvinphos)、三氯杀螨砜(tetradifon)、四唑虫酰胺(tetraniliprole)、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)、胺菊酯(tetramethrin)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、虫酰肼(tebufenozide)、吡螨胺(tebufenpyrad)、七氟菊酯(tefluthrin)、氟苯脲(teflubenzuron)、甲基内吸磷(demeton-S-methyl)、双硫磷(temephos)、溴氰菊酯(deltamethrin)、特丁硫磷(terbufos)、多拉菌素(Doramectin)、溴代吡咯脒(tralopyril)、四溴菊酯(tralomethrin)、四氟苯菊酯(transfluthrin)、啉蚜威(triazamate)、啉呀威(triazuron)、水杨菌胺(trichlamide)、敌百虫(trichlorphon: DEP)、三氟杀线酯(trifluenfurionate)、三氟苯嘧啶(triflumezopyrium)、杀铃脲(triflumuron)、啉虫酰胺(tolfenpyrad)、二溴磷(naled:BRP)、nicofluprole、硝虫噻嗪(nithiazine)、烯啶虫胺(nitenpyram)、氟酰脲(novaluron)、多氟脲(noviflumuron)、烯虫乙酯(hydroprene)、甲烯氟虫脒(vaniliprole)、蚜灭磷(vamidothion)、对硫磷(parathion)、甲基对硫磷(parathion-methyl)、苄螨醚(halfenprox)、氯虫酰肼(halofenozide)、双三氟虫脲(bistrifluron)、杀虫双(bisultap)、氟蚁脲(hydramethylnon)、羟丙基淀粉(hydroxy propyl starch)、乐杀螨(binapacryl)、pyflubumide、联苯肼酯(bifenazate)、联苯菊酯(bifenthrin)、吡蚜酮(pymetrozine)、吡啉硫磷(pyraclorfos)、吡啉氟虫脒(pyrafluprole)、啉啉硫磷(pyridafenthion)、啉螨灵(pyridaben)、啉虫丙醚(pyridalyl)、氟虫吡啶(pyrifluquinazon)、吡啉氟虫脒(pyriprole)、吡丙醚(pyriproxyfen)、抗蚜威(pirimicarb)、嘧啶醚(pyrimidifen)、嘧啶胺(pyriminostrobin)、甲基嘧啶磷(pirimiphos-methyl)、除虫菊素(pyrethrins)、氟虫脒(fipronil)、啉螨醚(fenazaquin)、苯线磷(fenamiphos)、溴螨酯(bromopropylate)、杀螟硫磷(fenitrothion:MEP)、苯氧威(fenoxycarb)、苯硫威(fenothiocarb)、苯醚菊酯(phenothrin)、仲丁威(fenobucarb)、丰索磷(fensulfothion)、倍硫磷(fenthion:MPP)、稻丰散(phenthoate:PAP)、氰戊菊酯(fenvalerate)、啉螨酯(fenpyroximate)、甲氰菊酯(fenpropathrin)、芬苯达唑(fenbendazole)、fenmezoditiaz、噻啉磷(fosthiazate)、伐虫脒(formetanate)、特嘧硫磷(butathiofos)、噻啉酮(buprofezin)、呋线威(furathiocarb)、右旋炔丙菊酯(prallethrin)、嘧啶酯(flucacrypyrim)、三氟咪啶酰胺(flauza-indolizine)、氟啶胺(flauzinam)、啉蜱脲(flauzuron)、氟噻虫砜

(fluensulfone)、fluxametamide、fluchlordiniliprole、氟环脲(flucycloxuron)、氟氰戊菊酯(flucythrinate)、氟胺氰菊酯(fluvalinate)、氟吡呋喃酮(flupyradifurone)、丁烯氟虫腈(flufiprole)、氟吡呋喃酮(flupyradifurone)、氟吡啉虫酯(flupyroxystrobin)、吡氟硫磷(flupyrazofos)、flupyrimin、噁虫胺(flufenexim)、氟菌酯(flufenoxystrobin)、氟虫脲(flufenoxuron)、氟螨啉(flufenazine)、三氟醚菊酯(flufenoprox)、苄螨啉(fluproxyfen)、溴氟菊酯(flubrocycythrinate)、fluhexafon、氟虫酰胺(flubendiamide)、flupentiofenox、氟氯苯菊酯(flumethrin)、噁虫胺(flurimfen)、丙硫磷(prothiofos)、普垂菊酯(protrifenbutate)、氟啉虫酰胺(flonicamid)、丙虫磷(propaphos)、炔螨特(propargite:BPPS)、丙溴磷(profenofos)、溴虫氟苯双酰胺(broflanilide)、丙氟菊酯(profluthrin)、残杀威(propoxur:PHC)、flometoquin、alpha-bromadiolone、溴螨酯(bromopropylate)、 β -氟氯氰菊酯(beta-cyfluthrin)、氟铃脲(hexaflumuron)、噁螨酮(hexythiazox)、右旋七氟甲醚菊酯(heptafluthrin)、庚烯磷(heptenophos)、氯菊酯(permethrin)、异噁虫啉(benclothiaz)、噁虫威(bendiocarb)、benzpyrimoxan、杀虫磺(bensultap)、苯螨特(benzoximate)、丙硫克百威(benfuracarb)、辛硫磷(phoxim)、伏杀硫磷(phosalone)、噁啉磷(fosthiazate)、丁硫环磷(fosthietan)、磷胺(phosphamidon)、磷虫威(phosphocarb)、亚胺硫磷(phosmet:PMP)、浏阳霉素复合物(polynactins)、伐虫脒(formetanate)、安硫磷(formothion)、甲拌磷(phorate)、机油(machine oil)、马拉硫磷(malathion)、米尔倍霉素(milbemycin)、米尔倍霉素A(milbemycin-A)、弥拜菌素(milbemectin)、灭蚜磷(mecarbam)、甲亚砷磷(mesulfenfos)、灭多威(methomyl)、四聚乙醛(metaldehyde)、氰氟虫脒(metaflumizone)、甲胺磷(methamidophos)、安百亩(metam-ammonium)、威百亩(metam-sodium)、甲硫威(methiocarb)、杀扑磷(methidathion:DMTP)、敌线酯(methylisothiocyanate)、甲基新癸酰胺(methylneodecanamide)、甲基对硫磷(methylparathion)、噁虫酮(metoxadiazone)、甲氧滴滴涕(methoxychlor)、甲氧虫酰肼(methoxyfenozide)、甲氧苄氟菊酯(metofluthrin)、烯虫酯(methoprene)、速灭威(metolcarb)、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、速灭磷(mevinphos)、久效磷(monocrotophos)、杀虫单(monosultap)、momfluorothrin、 λ -氯氟氰菊酯(lambda-cyhalothrin)、鱼尼汀(ryanodine)、虱螨脲(lufenuron)、rescalure、苄呋菊酯(resmethrin)、雷皮菌素(lepimectin)、鱼藤酮(rotenone)、盐酸左旋咪唑(levamisole hydrochloride)、苯丁锡(fenbutatin oxide)、酒石酸甲噻嘧啶(morantel tartarate)、溴甲烷(methyl bromide)、三环锡(cyhexatin)、氰氨化钙(calcium cyanamide)、石硫合剂(calcium polysulfide)、硫(sulfur)和硫酸烟碱(nicotine-sulfate)等。

[0371] 作为以同样的目的使用的用于农业园艺的杀菌剂,例如可举出:金色制霉素(aureofungin)、阿扎康唑(azaconazole)、氧化福美双(azithiram)、培塔酸(acypetacs)、活化酯(acibenzolar)、阿拉酸式苯-S-甲基(acibenzolar-S-methyl)、噁菌酯(azoxystrobin)、敌菌灵(anilazine)、吡啉磺菌胺(amisulbrom)、氨基磷酸(ampropylfos)、唑噁菌胺(ametocetradin)、烯丙醇(allyl alcohol)、4-十二烷基-2,6-二甲基吗啉(aldimorph)、代森铵(amobam)、异噁菌胺(isotianil)、氯苯咪菌酮(isovalledione)、吡啉萘菌胺(isopyrazam)、异丙噁菌胺(isofetamid)、isoflucypram、稻

瘟灵(isoprothiolane)、种菌唑(ipconazole)、ipfentrifluconazole、ipflufenquin、异菌脲(iprodione)、缬霉威(iprovalicarb)、异稻瘟净(iprobenfos)、抑霉唑(imazalil)、双胍辛胺(iminoctadine)、威百亩(metam)、双胍三辛烷基苯磺酸盐(iminoctadine-albesilate)、双胍辛胺乙酸盐(iminoctadine-triacetate)、亚胺唑(imibenconazole)、inpyrfluxam、烯效唑(uniconazole)、烯效唑-P(uniconazole-P)、氯唑灵(echlomezole)、敌瘟磷(edifenphos)、乙环唑(etaconazole)、噻唑菌胺(ethaboxam)、乙嘧酚(ethirimol)、代森硫(etem)、乙氧喹啉(ethoxyquin)、土菌灵(etr Diazole)、烯炔菌酯(enestroburin)、烯炔菌酯(enoxastrobin)、氟环唑(epoxiconazole)、噁霜灵(oxadixyl)、氟噻唑吡乙酮(oxathiapiprolin)、氧化萎锈灵(oxycarboxin)、8-羟基喹啉铜(copper-8-quinolinolate)、土霉素(oxytetracycline)、8-羟基喹啉铜(copper-oxinate)、噁咪唑(oxpoconazole)、噁咪唑富马酸盐(oxpoconazole-fumarate)、喹菌酮(oxolinic acid)、辛噻酮(octhilinone)、呋酰胺(ofurace)、炔醚菌胺(orysastrobin)、威百亩(carbam、metam-sodium)、春雷霉素(kasugamycin)、吗菌威(carbamorph)、环丙酰菌胺(carpropamid)、多菌灵(carbendazim)、萎锈灵(carboxin)、香芹酮(carvone)、喹菌胺(quinazamid)、羟基喹啉基乙酮(quinacetol)、苯氧喹啉(quinoxyfen)、quinofumelin、灭螨猛(chinomethionat)、灭螨猛(quinomethionate)、敌菌丹(captafol)、克菌丹(captan)、精苯霜灵(kiralaxyl)、唑啉菌酮(quinconazole)、五氯硝基苯(quintozene)、双胍辛乙酸盐(guazatine)、硫杂灵(cufraneb)、福美铜氯(cuprobam)、丁香菌酯(coumoxystrobin)、果绿啉(glyodin)、灰黄霉素(griseofulvin)、咪菌酮(climbazole)、甲酚(cresol)、醚菌酯(kresoxim-methyl)、乙菌利(chlozolate)、克霉唑(clotrimazole)、灭瘟唑(chlobenthiazole)、双胺灵(chloraniformethan)、四氯对醌(chloranil)、四氯喹啉(chlorquinox)、氯化苦(chloropicrin)、氯芬唑(chlorfenazole)、chloroinconazide、氯硝萘(chlorodinitronaphthalene)、百菌清(chlorothalonil)、地茂散(chloroneb)、水杨酰苯胺(salicylanilide)、氰菌胺(zarilamid)、氰霜唑(cyazofamid)、焦碳酸二乙酯(diethyl pyrocarbonate)、乙霉威(diethofencarb)、环菌胺(cyclafuramid)、双氯氰菌胺(diclocymet)、菌核利(dichlozoline)、苄氯三唑醇(diclobutrazol)、cyclobutrifluram、苯氟磺胺(dichlofluanid)、放线菌酮(cycloheximide)、dichlobentiazox、哒菌酮(diclomezine)、氯硝胺(dicloran)、双氯酚(dichlorophen)、二氯萘醌(dichlone)、双硫仑(disulfiram)、灭菌磷(ditalimfos)、二氰蒽醌(dithianon)、烯唑醇(diniconazole)、R-烯唑醇(diniconazole-M)、代森锌(zineb)、二硝巴豆酸酯(dinocap)、二硝酯(dinocton)、硝辛酯(dinosulfon)、硝丁酯(dinoterbon)、消螨通(dinobuton)、消戊酯(dinopenton)、dipymetitrone、双吡硫翁(dipyrrithione)、二苯胺(diphenylamine)、苯醚甲环唑(difenoconazole)、环氟苄酰胺(cyflufenamid)、氟嘧菌胺(diflumetorim)、环菌唑(cyproconazole)、嘧菌环胺(cyprodinil)、酯菌胺(cyprofuram)、氰菌灵(cypendazole)、硅氟唑(simeconazole)、二甲嘧酚(dimethirimol)、烯酰吗啉(dimethomorph)、霜脲氰(cymoxanil)、醚菌胺(dimoxystrobin)、福美辛(ziram)、硅噻菌胺(silthiofam)、链霉素(streptomycin)、螺环菌胺(spiroxamine)、戊苯砜(sultropen)、氟唑环菌胺(sedaxane)、苯酰菌胺(zoxamide)、棉隆(dazomet)、代森环(thiadiazin)、噻酰菌胺(tiadinil)、噻二氟(thiadifluor)、噻菌灵(thiabendazole)、硫氰苯甲酰胺(tioxymid)、硫氯苯亚胺

(thiochlorfenphim)、硫菌灵(thiophanate)、甲基硫菌灵(thiophanate-methyl)、噻呋酰胺(thifluzamide)、噻菌腈(thicyofen)、克杀螨(thioquinox)、福美双(thiram)、癸磷锡(decafentin)、四氯硝基苯(tecnazene)、叶枯酞(tecloftalam)、福美双联(tecoram)、四氟醚唑(tetraconazole)、咪菌威(debacarb)、脱氢乙酸(dehydroacetic acid)、戊唑醇(tebuconazole)、异丁乙氧喹啉(tebufloquin)、多地辛(dodicin)、多果定(dodine)、十二烷基苯磺酸双乙二胺铜盐(II) (DBEDC)、十二环吗啉(dodemorph)、肼菌酮(drazoxolon)、三唑醇(triadimenol)、三唑酮(triadimefon)、叶锈特(triazbutil)、咪唑嗪(triazoxide)、威菌磷(triamiphos)、啞菌醇(triarimol)、水杨菌胺(trichlamide)、氯啉菌酯(triclopyricarb)、三环唑(tricyclazole)、灭菌唑(triticonazole)、十三吗啉(tridemorph)、三丁基氧化锡(tributyltin oxide)、氟菌唑(triflumizole)、肼菌酯(trifloxystrobin)、嗪氨灵(triforine)、甲苯氟磺胺(tolylfluand)、甲基立枯磷(tolclofos-methyl)、tolprocarb、纳他霉素(natamycin)、代森钠(nabam)、硫氰散(nitrostyrene)、酞菌酯(nitrothal-isopropyl)、氟苯啞啉醇(nuarimol)、壬基苯酚磺酸铜(coppernonylphenol sulfonate)、丙烯酸喹啉酯(halacrinat)、井冈霉素(validamycin)、霜霉灭(valifenalate)、超敏蛋白(harpin protein)、四唑吡啉酯(picarbutrazox)、联苯吡菌胺(bixafen)、啉氧菌酯(picoxystrobin)、氟吡菌胺(picobenzamide)、氟唑菌酰胺(pydiflumetofen)、硫氯酚(bithionol)、联苯三唑醇(bitertanol)、土菌消(hydroxyisoxazole)、土菌消钾(hydroisoxazole-potassium)、乐杀螨(binapacryl)、联苯(biphenyl)、病花灵(piperalin)、噁霉灵(hymexazol)、唑菌酯(pyraoxystrobin)、吡喃灵(pyracarbolid)、吡唑醚菌酯(pyraclostrobin)、联苯吡嗪菌胺(pyraziflumid)、吡菌磷(pyrazophos)、pyrapropoyne、唑胺菌酯(pyrametostrobin)、氯芬丽(pyriofenone)、啉菌腈(pyridinitril)、pydiflumetofen、啉斑肼(pyrifenox)、啉菌噁唑(pyrisoxazole)、pyridachlometyl、啉斑肼(pyrifenox)、吡菌苯威(pyribencarb)、啞螨胺(pyriminostrobin)、啞霉胺(pyrimethanil)、氯甲氧吡啉(pyroxychlor)、氯吡呋醚(pyroxyfur)、咯喹酮(pyroquilon)、乙烯菌核利(vinclozolin)、福美铁(ferbam)、噁唑菌酮(famoxadone)、咪菌腈(fenapanil)、咪唑菌酮(fenamidone)、敌磺钠(fenaminosulf)、烯肼菌胺(fenaminstrobin)、氯苯啞啉醇(fenarimol)、种衣酯(fenitropan)、稻瘟酰胺(fenoxanil)、啞菌肼(ferimzone)、福美铁(ferbam)、三苯锡(fentin)、拌种咯(fenpiclonil)、fenpicoxamid、胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)、腈苯唑(fenbuconazole)、甲呋酰胺(fenfuram)、苯锈啉(fenpropidin)、丁苯吗啉(fenpropimorph)、环酞菌胺(fenhexamid)、四氯苯酞(phthalide)、丁硫啉(buthiobate)、丁胺(butylamine)、乙啞酚磺酸酯(bupirimate)、麦穗宁(fuberidazole)、灭瘟素(blasticidin-S)、呋吡菌胺(furametpyr)、呋霜灵(furalaxyl)、啞螨酯(flucacrypyrim)、氟啉胺(fluzinam)、氟茚唑菌胺(fluidapyr)、氟啞菌酯(fluxastrobin)、fluxapiprolin、fluoxytioconazole、三氟苯唑(flutrimazole)、氟吡菌胺(flupicolide)、Fluopimomide、氟吡菌酰胺(flupyram)、氟氯菌核利(fluoroimide)、二甲呋酰胺(furcarbanil)、氟唑菌酰胺(fluxapyroxad)、氟喹唑(flquinconazole)、呋菌唑(furconazole)、呋醚唑(furconazole-cis)、咯菌腈(fludioxonil)、氟硅唑(flusilazole)、磺菌胺(flusulfamide)、氟噻菌净(flutianil)、氟酰胺(flutolanil)、粉唑醇(flutriafol)、

flufenoxadiazam、氟菌螨酯(flufenoxystrobin)、糠醛(furfural)、flubeneteram、拌种胺(furmecyclo)、flumetylsulforim、氟酰菌胺(flumetover)、氟吗啉(flumorph)、丙氧喹啉(proquinazid)、咪鲜胺(prochloraz)、腐霉利(procymidone)、硫菌威(prothiocarb)、丙硫菌唑(prothioconazole)、pronitridine、霜霉威(propamocarb)、丙环唑(propiconazole)、丙森锌(propineb)、呋甲硫菌灵(furophanate)、烯丙苯噻唑(probenazole)、糠菌唑(bromuconazole)、florylpicoxamid、六氯丁二烯(hexachlorobutadiene)、己唑醇(hexaconazole)、环己硫磷(hexylthiofos)、吡托沙嗪(bethoxazin)、苯霜灵(benalaxyl)、精苯霜灵(benalaxyl-M)、麦锈灵(benodanil)、苯菌灵(benomyl)、稻瘟酯(pefurazoate)、醌肟脞(benquinox)、戊菌唑(penconazole)、苯杂吗(benzamorf)、戊菌隆(pencycuron)、苯甲羟肟酸(benzohydroxamic acid)、苯并烯氟菌唑(benzovindiflupyr)、丙唑草隆(bentaluron)、苯噻硫氰(benthiazole)、benthiavalicarb、苯噻菌胺异丙酯(benthiavalicarb-isopropyl)、吡噻菌胺(penthiopyrad)、氟唑菌苯胺(penflufen)、烟酰胺(boscalid)、氯瘟磷(phosdiphen)、三乙膦酸(fosetyl)、三乙膦酸铝(fosetyl-Al)、多氧霉素(polyoxins)、多抗霉素(polyoxorim)、代森福美锌(polycarbamate)、灭菌丹(folpet)、甲醛(formaldehyde)、机油(machine oil)、代森锰(manab)、代森锰锌(mancozeb)、双炔酰菌胺(mandipropamid)、mandestrobin、甲菌利(myclozolin)、腈菌唑(myclobutanil)、米多霉素(mildiomycin)、代森环(milneb)、苯并威(mecarbinzid)、磺菌威(methasulfocarb)、间氯敌菌酮(metazoxolon)、威百亩(metam)、威百亩钠盐(metam-sodium)、甲霜灵(metalaxyl)、精甲霜灵(metalaxyl-M)、metarylpicoxamid、代森联(metiram)、异硫氰酸甲酯(methyl isothiocyanate)、敌螨普(mepthyldinocap)、metyltetraprole、叶菌唑(metconazole)、噻菌胺(metsulfovax)、呋菌胺(methfuroxam)、苯氧菌胺(metominostrobin)、苯菌酮(metrafenone)、噻菌胺(mepanipyrim)、精甲霜灵(mefenoxam)、氯氟醚菌唑(mefentrifluconazole)、消螨多(meptyldinocap)、灭锈胺(mepronil)、邻酰胺(mebenil)、碘甲烷(iodomethane)、吡咪唑(rabenzazole)、溴甲烷(methylbromide)、苯扎氯铵(benzalkonium chloride)、碱式氯化铜(basic copper chloride)、碱式硫酸铜(basic copper sulfate)、金属银(silver)等无机灭菌剂、次氯酸钠(sodium hypochlorite)、氢氧化铜(cupric hydroxide)、水和硫剂(wettable sulfur)、石硫合剂(calcium polysulfide)、碳酸氢钾(potassium hydrogen carbonate)、碳酸氢钠(sodium hydrogen carbonate)、无机硫(sulfur)、无水硫酸铜(copper sulfate anhydride)、二甲氨基二硫代甲酸镍(nickel dimethyldithiocarbamate)、8-羟基喹啉铜(oxine copper)这样的铜类化合物、硫酸锌(zinc sulfate)和五水硫酸铜(copper sulfate pentahydrate)等。

[0372] 同样,作为除草剂,例如可举出:1-萘乙酰胺、2,4-PA、2,3,6-TBA、2,4,5-T、2,4,5-TB、2,4-D、2,4-DB、2,4-DEB、2,4-DEP、3,4-DA、3,4-DB、3,4-DP、4-CPA、4-CPB、4-CPP、MCP、MCPA、MCPA乙硫酯、MCPB、碘苯腈(ioxynil)、icafolin、icafolin-methyl、苯草醚(aclonifen)、唑啉草酮(azafenidin)、三氟羧草醚(acifluorfen)、叠氮津(aziprotryne)、四唑嘧磺隆(azimsulfuron)、磺草灵(asulam)、乙草胺(acetochlor)、莠去津(atrazine)、莠去通(atraton)、磺草隆(anisuron)、莎稗磷(anilofos)、四烯雌酮(aviglycine)、脱落酸(abscisic acid)、氨唑草酮(amicarbazone)、酰嘧磺隆(amidosulfuron)、杀草强

(amitrole)、环丙吡啶酸(aminocyclopyrachlor)、氯氨吡啶酸(aminopyralid)、特草嗉酮(amibuzin)、甲基胺草磷(amiprofos-methyl)、特津酮(ametridione)、莠灭净(ametryn)、甲草胺(alachlor)、二丙烯草胺(allidochlor)、禾草灭(alloxydim)、五氯戊酮酸(alorac)、iofensulfuron、异噁隆(isouron)、丁咪酰胺(isocarbamid)、异噁氯草酮(isoxachlortole)、异噁草醚(isoxapyrifop)、异噁唑草酮(isoxaflutole)、异噁酰草胺(isoxaben)、异草定(isocil)、异草完隆(isonoruron)、异丙隆(isoproturon)、异丙乐灵(isopropalin)、氮草草(isopolinate)、丁嗉草酮(isomethiozin)、抗倒胺(inabenfide)、抑草津(ipazine)、三唑草酰胺(iptriazopyrid)、三唑酸草胺(ipfencarbazone)、丙草定(iprymidam)、灭草喹(imazaquin)、甲基咪草烟(imazapic)、灭草烟(imazapyr)、甲基咪草烟(imazamethapyr)、咪草酸(imazamethabenz)、咪草甲酯(imazamethabenz-methyl)、甲氧咪草烟(imazamox)、咪草烟(imazethapyr)、唑吡嘧磺隆(imazosulfuron)、三嗪茛草胺(indaziflam)、茛草酮(indanofan)、吲哚丁酸(indolebutyric acid)、烯效唑-P(uniconazole-P)、甘草津(eglinazine)、戊草丹(esprocarb)、胺苯磺隆(ethametsulfuron)、胺苯磺隆甲酯(ethametsulfuron-methyl)、乙丁烯氟灵(ethalfluralin)、硫草敌(ethiolate)、吲熟酯(ethychlozate ethyl)、磺噻隆(ethidimuron)、硝草酚(etinofen)、乙烯利(ethephon)、乙氧磺隆(ethoxysulfuron)、氯氟草醚(ethoxyfen)、乙胺草醚(etnipromid)、乙氧呋草黄(ethofumesate)、乙氧苯草胺(etobenzanid)、epyrifenacil、三唑磺(epronaz)、抑草蓬(erbon)、草藻灭(endothal)、噁草酮(oxadiazon)、丙炔噁草酮(oxadiargyl)、噁嗉草酮(oxaziclomefone)、环氧嘧磺隆(oxasulfuron)、草啞松(oxapyrazon)、乙氧氟草醚(oxyfluorfen)、氨磺乐灵(oryzalin)、嘧苯胺磺隆(orthosulfamuron)、坪草丹(orbencarb)、唑草胺(cafenstrole)、克草胺酯(cambendichlor)、卡巴草灵(carbasulam)、唑草酮(carfentrazone)、唑酮草酯(carfentrazone-ethyl)、特胺灵(karbutilate)、草长灭(carbetamide)、特噁唑威(carboxazole)、喹禾灵(quizalofop)、精喹禾灵(quizalofop-P)、喹禾灵乙酯(quizalofop-ethyl)、二甲苯草胺(xylachlor)、灭藻醌(quinoclamine)、氯藻胺(quinonamid)、二氯喹啉酸(quinclorac)、氯甲喹啉酸(quinmerac)、苜草隆(cumyluron)、氯酰草膦(clacyfos)、碘氯啶酯(cliodinate)、草甘膦(glyphosate)、草铵膦(glufosinate)、精草铵膦(glufosinate-P)、醚草敏(credazine)、烯草酮(clethodim)、座果酸(cloxyfonac)、炔草酸(clodinafop)、炔草酯(clodinafop-propargyl)、绿麦隆(chlorotoluron)、二氯吡啶酸(clopyralid)、环丁烯草酮(cloproxydim)、调果酸(cloprop)、氯溴隆(chlorbromuron)、氯丁草(clofop)、异噁草松(clomazone)、氯硝醚(chlomethoxynil)、甲氧除草醚(chlomethoxyfen)、氯甲酰草胺(clomeprop)、炔禾灵(chlorazifop)、可乐津(chlorazine)、丁酰草胺(chloranocryl)、草灭畏(chloramben)、cloransulam、氯酯磺草胺(cloransulam-methyl)、氯草敏(chloridazon)、氯嘧磺隆(chlorimuron)、氯嘧磺隆乙酯(chlorimuron-ethyl)、氯磺隆(chlorsulfuron)、敌草索(chlorthal)、氯硫酰草胺(chlorthiamid)、绿麦隆(chlortoluron)、草枯醚(chlornitrofen)、伐草克(chlorfenac)、燕麦酯(chlorfenprop)、氯炔灵(chlorbufam)、氯酰亚胺(chlorphthalim)、氟咪杀(chlorflurazole)、氯甲丹(chlorflurenol)、草败死(chlorprocarb)、氯苯胺灵(chlorpropham)、矮壮素(chlormequat)、乙氧苯隆

(chloreturon)、羟敌草腈(chloroxynil)、枯草隆(chloroxuron)、绿麦隆(chlorotoluron)、三氯丙酸(chloropon)、苯嘧磺草胺(saflufenacil)、氰草津(cyanazine)、氰草净(cyanatryn)、燕麦敌(di-allate)、敌草隆(diuron)、二乙除草双(diethamquat)、dioxopyritrione、麦草畏(dicamba)、环莠隆(cycluron)、环草敌(cycloate)、噻草酮(cycloxydim)、双氯磺草胺(diclosulam)、环丙嘧磺隆(cyclosulfamuron)、cyclopyranil、cyclopyrimorate、2,4-滴丙酸(dichlorprop)、精2,4-滴丙酸(dichlorprop-P)、敌草腈(dichlobenil)、禾草灵(diclofop)、禾草灵甲酯(diclofop-methyl)、苄胺灵(dichlormate)、氯全隆(dichloralurea)、敌草快(diquat)、咯草隆(cisanilide)、2,4-滴硫钠(disul)、环草隆(siduron)、氟硫草定(dithiopyr)、氨基灵(dinitramine)、吲哚酮草酯(cinidon-ethyl)、戊硝酚(dinosam)、醚磺隆(cinosulfuron)、地乐酚(dinoseb)、特乐酚(dinoterb)、地乐特(dinofenate)、硝丙酚(dinoprop)、氰氟草酯(cyhalofop-butyl)、cypyrafluone、双苯酰草胺(diphenamid)、枯莠隆(difenoxuron)、戊味禾草灵(difenopenten)、野燕枯(difenzoquat)、洒布净(cybutryne)、环丙津(cyprazine)、三环赛草胺(cyprazole)、吡氟酰草胺(diflufenican)、氟吡草胺(diflufenzopyr)、异丙净(dipropetryn)、环酰草胺(cypromid)、牧草快(cyperquat)、赤霉素(gibberellin)、西玛津(simazine)、草灭散(dimexano)、dimesulfazet、二甲草胺(dimethachlor)、草啞酮(dimidazon)、异戊津(dimethametryn)、二甲吩草胺(dimethenamid)、西草净(simetryn)、西玛通(simeton)、哌草丹(dimepiperate)、噁隆(dimefuron)、环庚草醚(cinmethylin)、灭草灵(sweep)、吡庚磺酯(sulglycapin)、磺草酮(sulcotrione)、菜草畏(sulfallate)、甲磺草胺(sulfentrazone)、磺酰磺隆(sulfosulfuron)、甲嘧磺隆(sulfometuron)、甲嘧磺隆甲酯(sulfometuron-methyl)、仲丁通(secbumeton)、稀禾定(sethoxydim)、另丁津(sebuthylazine)、特草定(terbacil)、杀草隆(daimuron)、棉隆(dazomet)、茅草枯(dalapon)、噻氟隆(thiazafluron)、噻草定(thiazopyr)、氟嘧硫草酯(tiafenacil)、噻酮磺隆(thiencarbazone)、噻酮磺隆甲酯(thiencarbazone-methyl)、仲草丹(tiocarbazil)、嘧草胺(tioclorim)、禾草丹(thiobencarb)、噻二唑草胺(thidiazimin)、噻苯隆(thidiazuron)、噻吩磺隆(thifensulfuron)、噻吩磺隆甲酯(thifensulfuron-methyl)、甜菜安(desmedipham)、敌草净(desmetryn)、tetflupyrolimet、四氟隆(tetrafluron)、噻吩草胺(thenylchlor)、牧草胺(tebutam)、丁噻隆(tebuthiuron)、特丁通(terbumeton)、吡喃草酮(tepraloxym)、特糠酯酮(tefuryltrione)、环磺酮(tembotrione)、异丁草胺(delachlor)、特草定(terbacil)、特草灵(terbucarb)、特丁草胺(terbuchlor)、特丁津(terbuthylazine)、特丁净(terbutryn)、苯吡唑草酮(topramezone)、三甲苯草酮(tralkoxydim)、三嗪氟草胺(triaziflam)、醚苯磺隆(triasulfuron)、氟酮磺草胺(triafamone)、野麦畏(tri-allate)、草达津(trietazine)、杀草畏(tricamba)、三氯吡氧乙酸(triclopyr)、灭草环(tridiphane)、草达克(tritac)、三氟甲磺隆(tritosulfuron)、tripyrasulfone、三氟草啉(trifludimoxazin)、氟胺磺隆(triflusulfuron)、氟胺磺隆甲酯(triflusulfuron-methyl)、氟乐灵(trifluralin)、三氟啶磺隆(trifloxysulfuron)、茛草酮(tripropindan)、苯磺隆(tribenuron)、苯磺隆甲酯(tribenuron-methyl)、三氟苯氧丙酸(trifop)、三氟禾草肟(trifopsime)、三甲隆(trimeturon)、tolpyralate、萘草胺

(naptalam)、萘丙胺(naproanilide)、敌草胺(napropamide)、烟嘧磺隆(nicosulfuron)、甲磺乐灵(nitralin)、除草醚(nitrofen)、三氟甲草醚(nitrofluorfen)、氟氯草胺(nipyraclofen)、草不隆(neburon)、吡草伏(norflurazon)、草完隆(noruron)、燕麦灵(barban)、多效唑(paclobutrazol)、百草枯(paraquat)、对氟隆(parafluron)、氟啶草(haloxydine)、氟氯吡啶酸(halauxifen)、氟吡禾灵(haloxyfop)、高效氟吡甲禾灵(haloxyfop-P)、氟吡甲禾灵(haloxyfop-methyl)、氟硝磺酰胺(halosafen)、氯吡嘧磺隆(halosulfuron)、氯吡嘧磺隆甲酯(halosulfuron-methyl)、双丙氨酰膦(bilanafos)、二氯异噁草酮(bixlozone)、氨基吡啶酸(picloram)、氟吡酰草胺(picolinafen)、氟吡草酮(bicyclopyrone)、双草醚(bispyribac)、双草醚钠盐(bispyribac-sodium)、比达农(pydanon)、唑啉草酯(pinoxaden)、bipyrazone、甲酸除草醚(bifenox)、哌草磷(piperophos)、噁霉灵(hymexazol)、吡唑啉草酯(pyraquinate)、双唑草腈(pyraclonil)、磺酰草吡唑(pyrasulfotole)、苣草唑(pyrazoxyfen)、吡嘧磺隆(pyrazosulfuron)、吡嘧磺隆乙酯(pyrazosulfuron-ethyl)、吡唑特(pyrazolate)、双丙氨酰膦(bilanafos)、吡草醚(pyraflufen-ethyl)、三氯吡啶酚(pyriclor)、吡草醇(pyridafol)、嘧草硫醚(pyriithiobac)、嘧草硫醚钠盐(pyriithiobac-sodium)、吡草特(pyridate)、环酯草醚(pyriftalid)、稗草丹(pyributicarb)、氟嘧啶草醚(pyriflubenoxim)、嘧啶肟草醚(pyribenzoxim)、嘧磺苯胺(pyrimisulfan)、氟嘧磺隆(primisulfuron)、嘧草醚(pyriminobac-methyl)、砒吡草唑(pyroxasulfone)、甲氧磺草胺(pyroxulam)、砒苯磺威(fenasulam)、棉胺宁(phenisopham)、非草隆(fenuron)、异噁苯砒(fenoxasulfone)、噁唑禾草灵(fenoxaprop)、精噁唑禾草灵(fenoxaprop-P)、噁唑禾草灵乙酯(fenoxaprop-ethyl)、酚硫杀(phenothiol)、2,4,5-涕丙酸(fenoprop)、砒草隆(phenobenzuron)、fenquinotrine、噁唑禾草灵(fenthiaprop)、氯苯氧乙醇(fenteracol)、四唑砒草胺(fentrazamide)、fenpyrazone、甜菜宁(phenmedipham)、甜菜宁乙酯(phenmedipham-ethyl)、丁草胺(butachlor)、氟丙嘧草酯(butafenacil)、抑草磷(butamifos)、丁噁隆(buthiuron)、特咪唑草(buthidazole)、丁草敌(butylate)、炔草隆(buturon)、丁烯草胺(butenachlor)、丁苯草酮(butroxydim)、仲丁灵(butralin)、丁苯草酮(butroxydim)、啶嘧磺隆(flazasulfuron)、麦草氟(flamprop)、呋氧草醚(furyloxyfen)、丙炔草胺(prynachlor)、氟嘧磺隆甲酯(primisulfuron-methyl)、吡氟禾草灵(fluzafop)、精吡氟禾草灵(fluzafop-P)、吡氟禾草灵丁酯(fluzafop-butyl)、异丙吡草酯(fluzolate)、氟草烟(fluroxypyr)、氟硫隆(fluothiuron)、氟草隆(fluometuron)、乙羧氟草醚(fluoroglyphosate)、氟咯草酮(flurochloridone)、三氟硝草醚(fluorodifen)、氟除草醚(fluoronitrofen)、唑啉草(fluoromidifluthiacet)、氟唑磺隆(flucarbazone)、氟唑磺隆钠盐(flucarbazone-sodium)、氟氯氨草酯(fluchloraminopyr)、氟氯氨草酸糠酯(fluchloraminopyr-tefuryl)、氯乙氟灵(fluchloralin)、氟吡磺隆(flucetosulfuron)、噻草酸(fluthiacet)、噻草酸甲酯(fluthiacet-methyl)、氟砒草胺(flusulfimam)、氟啶嘧磺隆(flupyrasulfuron)、氟噻草胺(flufenacet)、氟苯啶草(flufenican)、氟草啶(flufenoximacil)、氟吡啶草酯(flufenpyr)、氟丙嘧草酯(flupropacil)、四氟丙酸(flupropanate)、氟胺草唑(flupoxam)、丙炔氟草胺(flumioxazin)、氟烯草酸(flumiclorac)、氟烯草酸戊酯(flumiclorac-pentyl)、炔草胺(flumipropyn)、三氟噁嗪

(flumezin)、氟草隆(fluometuron)、唑啉磺草胺(flumetsulam)、氟啶草酮(fluridone)、呋草酮(flurtamone)、氟草烟(fluroxypyr)、丙草胺(pretilachlor)、扑灭生(proxan)、甘扑津(proglinazine)、环丙腈津(procyazine)、氨氟乐灵(prodiamine)、甲硫磺乐灵(prosulfalin)、氟磺隆(prosulfuron)、苄草丹(prosulfocarb)、啶草酸(propaquizafop)、毒草胺(propachlor)、扑灭津(propazine)、敌稗(propanil)、炔苯酰甲胺(propyzamide)、异丙草胺(propisochlor)、茉莉酮(prohydrojasmon)、噻咪唑啉磺隆(propyrisulfuron)、苯胺灵(propham)、氟唑草胺(profluzol)、环丙氟灵(profluralin)、调环酸钙(prohexadione-calcium)、丙苯磺隆(propoxycarbazone)、丙苯磺隆钠盐(propoxycarbazone-sodium)、环苯草酮(profoxydim)、除草定(bromacil)、溴草敏(brompyrazon)、扑草净(prometryn)、扑灭通(prometon)、溴苯腈(bromoxynil)、溴酚肟(bromofenoxim)、溴丁酰草胺(bromobutide)、糠草腈(bromobonil)、双氟磺草胺(florasulam)、florpyrauxifen、六氯丙酮(hexachloroacetone)、环嗪酮(hexazinone)、烯草胺(pethoxamid)、草除灵(benazolin)、五氟磺草胺(penoxsulam)、克草敌(pebulate)、氟丁酰草胺(beflubutamid)、beflubutamid-M、灭草敌(vernolate)、黄草伏(perfluidone)、苯唑磺隆(bencarbazone)、benquitrione、胺酸杀(benzadox)、苄草胺(benzipram)、苄基氨基嘌呤(benzylaminopurine)、苯噻隆(benzthiazuron)、双苯唑草酮(benzfendizone)、地散磷(bensulide)、苄唑磺隆甲酯(bensulfuron-methyl)、新燕灵(benzoylprop)、双环磺草酮(benzobicyclon)、吡草酮(benzofenap)、氟草黄(benzofluor)、灭草松(bentazone)、甲氯酰草胺(pentanochlor)、禾草丹(benthiocarb)、二甲戊灵(pendimethalin)、环戊噁草酮(pentoxazone)、乙丁氟灵(benfluralin)、呋草黄(benfuresate)、蔓草磷(fosamine)、氟磺胺草醚(fomesafen)、甲酰氨基唑啉磺隆(foramsulfuron)、氯吡脲(forchlorfenuron)、抑芽丹(maleic hydrazide)、2-甲-4-氯丙酸(mecoprop)、精-2-甲-4-氯丙酸(mecoprop-P)、地乐施(medinoterb)、甲基二磺隆(mesosulfuron)、甲基二磺隆甲酯(mesosulfuron-methyl)、甲基磺草酮(mesotrione)、灭莠津(mesoprazine)、格草净(methoprotryne)、吡草胺(metazachlor)、灭草唑(methazole)、双醚氯吡唑磺隆(metazosulfuron)、甲基苯噻隆(methabenzthiazuron)、苯噻草酮(metamitron)、噁唑酰草胺(metamifop)、威百亩(metam)、氟烯硝草(methalpropalin)、灭草恒(methiuron)、异噁唑草醚(methiozolin)、甲硫苯威(methiobencarb)、甲基杀草隆(methyldymron)、甲氧隆(metoxuron)、磺草唑胺(metosulam)、甲磺隆(metsulfuron)、甲磺隆甲酯(metsulfuron-methyl)、氟啶草(metflurazon)、溴谷隆(metobromuron)、吡喃隆(metobenzuron)、醚草通(methometon)、异丙甲草胺(metolachlor)、噻草酮(metribuzin)、甲哌鎗(mepiquat-chloride)、苯噻酰草胺(mefenacet)、氟磺酰草胺(mefluidide)、庚酰草胺(monalide)、特噁唑隆(monisouron)、灭草隆(monuron)、一氯乙酸(monochloroacetic acid)、绿谷隆(monolinuron)、禾草敌(molinate)、伐草快(morfamquat)、碘磺隆(iodosulfuron)、碘磺隆甲酯钠盐(iodosulfuron-methyl-sodium)、碘草腈(iodobonil)、碘甲烷(iodomethane)、乳氟禾草灵(lactofen)、lancotrione、利谷隆(linuron)、rimisoxafen、砒唑磺隆(rimsulfuron)、环草定(lenacil)、硫氰苯胺(rhodethanil)、过氧化钙(calcium peroxide)和溴甲烷(methyl bromide)等。

[0373] 此外,作为生物农药,例如通过与核多角体病毒(Nuclear polyhedrosis virus、

NPV)、颗粒体病毒(Granulosis virus、GV)、细胞质多角体病病毒(Cytoplasmic polyhedrosis virus、CPV)、昆虫痘病毒(Entomopoxi virus、EPV)等病毒制剂、瘤捕单顶孢(Monacrosporium phymatophagum)、小卷蛾斯氏线虫(Steinernema carpocapsae)、昆虫病原型斯氏线虫(Steinernema kushidai)、穿刺巴斯德氏芽菌(Pasteuria penetrans)等用作杀虫或杀线虫剂的微生物农药、木素木霉(Trichoderma lignorum)、放射性农杆菌(Agrobacterium radiobactor)、非病原性胡萝卜软腐欧文氏菌(Erwinia carotovora)、枯草芽孢杆菌(Bacillus subtilis)等用作灭菌剂的微生物农药、野油菜黄单胞菌(Xanthomonas campestris)等用作除草剂的生物农药等混合使用,能够期待同样的效果。

[0374] 此外,作为生物农药,例如还可与下述成分组合使用:丽蚜小蜂(Encarsia formosa)、科列马阿布拉小蜂(Aphidius colemani)、食蚜瘿蚊(Aphidoletes aphidimyza)、豌豆潜叶蝇姬小蜂(Diglyphus isaea)、西伯利亚离颚茧蜂(Dacnusa sibirica)、智利小植绥螨(Phytoseiulus persimilis)、黄瓜钝绥螨(Amblyseius cucumeris)、东亚小花蝽(Orius sauteri)等天敌生物、卵孢白僵菌(Beauveria brongniartii)等微生物农药、(Z)-10-十四碳烯乙酸酯、(E,Z)-4,10-十四碳二烯乙酸酯、(Z)-8-十二碳烯乙酸酯、(Z)-11-十四碳烯乙酸酯、(Z)-13-二十碳-10-酮、14-甲基-1-十八碳烯等信息素。

[0375] 实施例

[0376] 在下文中例举本发明的代表性的实施例,但本发明不限于此。

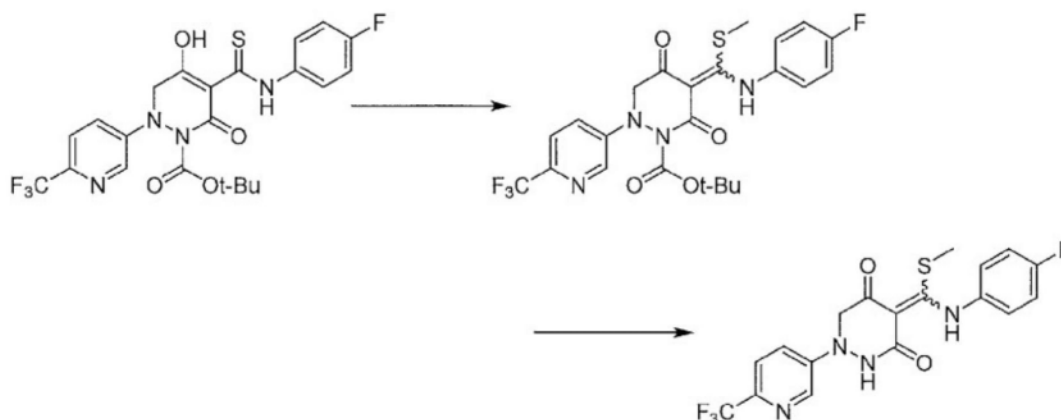
[0377] 制造实施例1

[0378] (5E)-5-(((4-氟苯基)氨基)(甲硫基)亚甲基)-4,6-二氧化-2-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-四氢哒嗪-1(2H)-羧酸叔丁酯(化合物编号1-63)和(4E)-4-(((4-氟苯基)氨基)(甲硫基)亚甲基)-1-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-四氢哒嗪-1(2H)-3,5-二酮(化合物编号1-1)的制造

[0379] 制造实施例1-1

[0380] (5E)-5-(((4-氟苯基)氨基)(甲硫基)亚甲基)-4,6-二氧化-2-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-四氢哒嗪-1(2H)-羧酸叔丁酯(化合物编号1-63)的制造

[0381] [化学式20]



[0383] 向5-((4-氟苯基)氨基甲酰基硫代)-4-羟基-6-氧代-2-(6-(三氟甲基)吡啶-3-基)-2,3-二氢哒嗪-1(6H)-羧酸叔丁酯(200mg,0.391mmol)的乙腈(5mL)溶液中依次添加碳酸钾(75.0mg,0.547mmol)、碘甲烷(67.0mg,0.469mmol),在室温下搅拌1.2小时。向反应液

添加饱和氯化铵水溶液,用乙酸乙酯提取,用饱和食盐水清洗有机层后,用无水硫酸钠干燥,减压浓缩。通过用硅胶柱层析纯化残渣,而得到(5EZ)-5-(((4-氟苯基)氨基)(甲硫基)亚甲基)-4,6-二氧化-2-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-四氢吡嗪-1(2H)-羧酸叔丁酯(174mg, 0.331mmol)。

[0384] 收率:85%

[0385] 物理性质: $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 /TMS, ppm) δ 8.19 (d, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.21 (d, 1H), 6.79-6.63 (brs, 4H), 4.25-3.85 (brs, 2H), 2.11 (s, 3H), 1.41 (s, 9H)

[0386] 制造实施例1-2

[0387] (4EZ)-4-(((4-氟苯基)氨基)(甲硫基)亚甲基)-1-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-四氢吡嗪-1(2H)-3,5-二酮(化合物编号1-1)的制造

[0388] 将(5EZ)-5-(((4-氟苯基)氨基)(甲硫基)亚甲基)-4,6-二氧化-2-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-四氢吡嗪-1(2H)-羧酸叔丁酯(34.7mg, 0.0660mmol)溶解在三氟乙酸(1mL)中,在室温下搅拌3.3小时。减压浓缩反应液后,添加饱和氯化铵水溶液,用乙酸乙酯提取。用饱和食盐水清洗有机层后,用无水硫酸钠干燥,减压浓缩,而得到(4EZ)-4-(((4-氟苯基)氨基)(甲硫基)亚甲基)-1-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-四氢吡嗪-1(2H)-3,5-二酮(23.9mg, 0.0561mmol)。

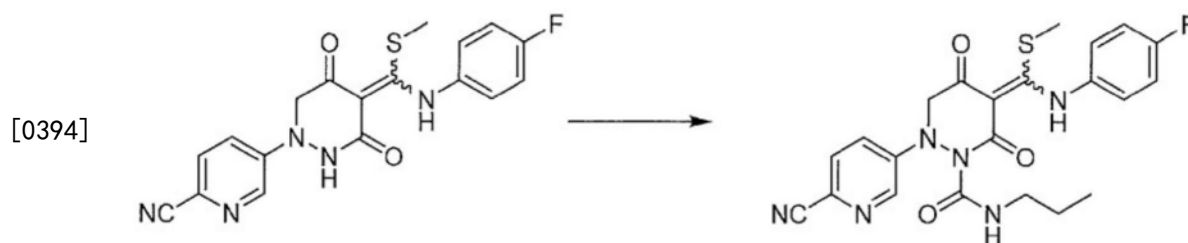
[0389] 收率:85%

[0390] 物理性质:熔点158-159°C

[0391] 制造实施例2

[0392] (5EZ)-2-(6-氰基吡啶-3-基)-5-(((4-氟苯基)氨基)(甲硫基)亚甲基)-4,6-二氧化-N-丙基-四氢吡嗪-1(2H)-羧酰胺(化合物编号1-182)的制造

[0393] [化学式21]



[0395] 向(4EZ)-5-(4-(((4-氟苯基)氨基)(甲硫基)亚甲基)-3,5-二氧化四氢吡嗪-1(2H)-基)氰基吡啶(83mg, 0.22mmol)的氯仿(1.5mL)溶液中添加异氰酸丙酯(23 μ L, 0.24mmol)和N,N-二异丙基乙胺(44 μ L, 0.26mmol),在室温下搅拌24小时。反应结束后,向反应液添加1给定盐酸,用乙酸乙酯提取2次。将有机层用1给定盐酸、饱和食盐水清洗,用无水硫酸钠干燥后,减压浓缩。向得到的残渣添加少量的乙酸乙酯、MTBE使其结晶化后,抽滤,用MTBE清洗,而得到(5EZ)-2-(6-氰基吡啶-3-基)-5-(((4-氟苯基)氨基)(甲硫基)亚甲基)-4,6-二氧化-N-丙基-四氢吡嗪-1(2H)-羧酰胺(55mg, 0.12mmol)。

[0396] 收率:55%

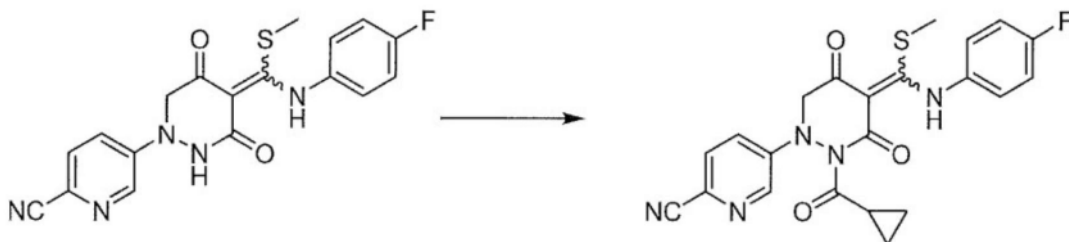
[0397] 物理性质:熔点190-191°C

[0398] 制造实施例3

[0399] (4EZ)-5-(2-(环丙烷羰基)-4-(((4-氟苯基)氨基)(甲硫基)亚甲基)-3,5-二氧化-四氢吡嗪-1(2H)-基)氰基吡啶(化合物编号1-44)的制造

[0400] [化学式22]

[0401]



[0402] 向(4E)-5-(4-(((4-氟苯基)氨基)(甲硫基)亚甲基)-3,5-二氧代四氢哒嗪-1(2H)-基)氰基吡啶(0.12g,0.32mmol)的氯仿(1.6mL)溶液中添加环丙基羰基氯化物(32 μ L,0.35mmol)和N,N-二异丙基乙胺(65 μ L,0.38mmol),在室温下搅拌30分钟。向反应溶液添加4-二甲基氨基吡啶(8.2mg,63 μ mol),在室温下搅拌2小时。反应结束后,向反应液添加1给定盐酸,用乙酸乙酯提取2次。将有机层用1给定盐酸、饱和食盐水清洗,用无水硫酸钠干燥后,减压浓缩。通过用硅胶柱层析纯化得到的残渣,而得到(4E)-5-(2-(环丙烷羰基)-4-(((4-氟苯基)氨基)(甲硫基)亚甲基)-3,5-二氧代四氢哒嗪-1(2H)-基)氰基吡啶(56mg,0.12mmol)。

[0403] 收率:39%

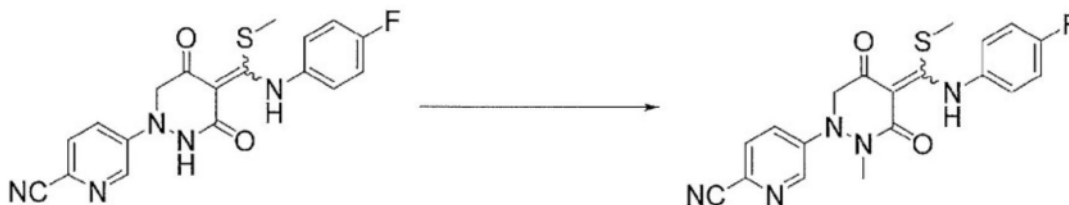
[0404] 物理性质:熔点207-208 $^{\circ}$ C

[0405] 制造实施例4

[0406] (4E)-5-(4-(((4-氟苯基)氨基)(甲硫基)亚甲基)-2-甲基-3,5-二氧代四氢哒嗪-1(2H)-基)氰基吡啶(化合物编号1-197)的制造

[0407] [化学式23]

[0408]



[0409] 将(4E)-5-(4-(((4-氟苯基)氨基)(甲硫基)亚甲基)-3,5-二氧代四氢哒嗪-1(2H)-基)氰基吡啶(0.20g,0.52mmol)溶解在脱水N,N-二甲基乙酰胺(2.0mL)中,冷却至0 $^{\circ}$ C。添加氢化钠(53mg,1.2mmol)在0 $^{\circ}$ C下搅拌10分钟后,添加碘甲烷(36 μ L,0.57mmol),在室温下搅拌1小时。添加1给定盐酸用乙酸乙酯提取后,将有机相用1给定盐酸、饱和食盐水清洗,用无水硫酸钠干燥。减压蒸馏除去溶剂后,过滤析出的固体,而得到(4E)-5-(4-(((4-氟苯基)氨基)(甲硫基)亚甲基)-2-甲基-3,5-二氧代四氢哒嗪-1(2H)-基)氰基吡啶(99mg,0.25mmol)。

[0410] 收率:48%

[0411] 物理性质:熔点237-238 $^{\circ}$ C

[0412] 参考实施例1

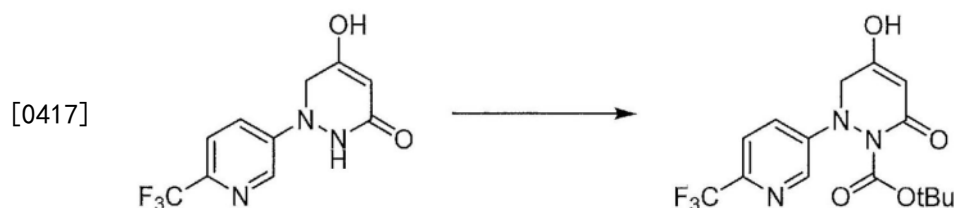
[0413] 5-((4-氟苯基)氨基甲酰基硫代)-4-羟基-6-氧代-2-(6-(三氟甲基)吡啶-3-基)-2,3-二氢哒嗪-1(6H)-羧酸叔丁酯的制造

[0414] 参考实施例1-1

[0415] 4-羟基-6-氧代-2-(6-(三氟甲基)吡啶-3-基)-2,3-二氢哒嗪-1(6H)-羧酸叔丁酯

的制造

[0416] [化学式24]



[0418] 在冰冷下,向5-羟基-1-(6-(三氟甲基)吡啶-3-基)-1,6-二氢哒嗪-3(2H)-酮(2.7g,10.6mmol)的氯仿(10mL)溶液中添加二碳酸二叔丁酯(2.5g,11.6mmol)和N,N-二甲基-4-氨基吡啶(1.28g,10.6mmol),在室温下搅拌3小时。添加硫酸氢钾水溶液,用乙酸乙酯提取3次。将有机层用硫酸镁干燥后,减压浓缩。通过用柱层析纯化得到的残渣,而得到4-羟基-6-氧代-2-(6-(三氟甲基)吡啶-3-基)-2,3-二氢哒嗪-1(6H)-羧酸叔丁酯(1.85g,4.56mmol)。

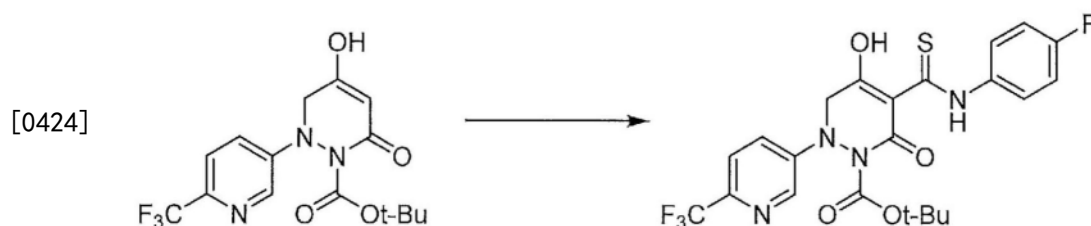
[0419] 收率:43%

[0420] 物理性质: $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3/TMS , ppm) δ 8.35 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.21 (d, 1H), 4.64 (brs, 1H), 4.19 (brs, 1H), 3.98 (s, 3H), 3.47 (s, 2H)

[0421] 参考实施例1-2

[0422] 5-((4-氟苯基)氨基甲酰基硫代)-4-羟基-6-氧代-2-(6-(三氟甲基)吡啶-3-基)-2,3-二氢哒嗪-1(6H)-羧酸叔丁酯的制造

[0423] [化学式25]



[0425] 向4-羟基-6-氧代-2-(6-(三氟甲基)吡啶-3-基)-2,3-二氢哒嗪-1(6H)-羧酸叔丁酯(200mg,0.56mmol)的二甲基乙酰胺(2mL)溶液中依次添加4-氟苯基异硫氰酸酯(75 μl ,0.61mmol)和碳酸铯(200mg,0.45mmol),在室温下搅拌2小时。向反应溶液添加1N盐酸,用乙酸乙酯提取。将有机层用无水硫酸镁干燥后,减压浓缩。通过用硅胶柱层析纯化得到的残渣,而得到5-((4-氟苯基)氨基甲酰基硫代)-4-羟基-6-氧代-2-(6-(三氟甲基)吡啶-3-基)-2,3-二氢哒嗪-1(6H)-羧酸叔丁酯(58mg,0.112mmol)。

[0426] 收率:20%

[0427] 物理性质: $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3/TMS , ppm) δ 17.32 (s, 1H), 12.82 (brs, 1H), 8.41 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.40-7.35 (m, 4H), 7.15-7.09 (m, 2H), 4.65 (s, 2H), 1.55 (s, 9H)

[0428] 在下文中显示制剂例,但不限于此。制剂例中,份表示重量份。

[0429] 制剂例1.

[0430] 本发明化合物10份

[0431] 二甲苯70份

[0432] N-甲基吡咯烷酮10份

- [0433] 聚氧乙烯壬基苯基醚与烷基苯磺酸钙的混合物10份
- [0434] 将以上均匀地混合溶解而制成乳剂。
- [0435] 制剂例2.
- [0436] 本发明化合物3份
- [0437] 黏土粉末82份
- [0438] 硅藻土粉末15份
- [0439] 将以上均匀地混合粉碎而制成粉剂。
- [0440] 制剂例3.
- [0441] 本发明化合物5份
- [0442] 膨润土与黏土的混合粉末90份
- [0443] 木质素磺酸钙5份
- [0444] 将以上均匀地混合,添加适量的水进行混炼,造粒,干燥而制成粒剂。
- [0445] 制剂例4.
- [0446] 本发明化合物20份
- [0447] 高岭土和合成高分散硅酸75份
- [0448] 聚氧乙烯壬基苯基醚与烷基苯磺酸钙的混合物5份
- [0449] 将以上均匀地混合粉碎而制成可湿性粉剂。
- [0450] 在下文中显示生物试验的实施例,但本发明不限于这些
- [0451] 试验例1.针对小菜蛾(*Plutella xylostella*)的杀虫试验
- [0452] 将小菜蛾的成虫放生至白菜幼苗,使其产卵,放生2天后,将带有产下的卵的白菜幼苗在将以本发明的通式(1)表示的化合物为有效成分的药剂稀释成50ppm或500ppm而得到的药液中浸渍约30秒,风干后,在25℃的恒温室静置。药液浸渍6天后,调查生存虫数,通过下述式计算校正死虫率,根据下述判定基准进行判定。1区10只3次重复。
- [0453] [数学式1]

$$[0454] \quad \text{校正死虫率(\%)} = \frac{(\text{无处理区生存率} - \text{处理区生存率})}{(\text{无处理区生存率})} \times 100$$

- [0455] 判定基准.
- [0456] A...死虫率100%
- [0457] B...死虫率99%~90%
- [0458] C...死虫率89%~80%
- [0459] D...死虫率79%~50%
- [0460] E...死虫率49%~0%
- [0461] 其结果,针对小菜蛾,本发明的通式(1)表示的化合物中,化合物编号1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-14、1-15、1-17、1-18、1-29、1-34、1-35、1-36、1-38、1-40、1-44、1-53、1-54、1-63、1-64、1-65、1-66、1-68、1-69、1-70、1-71、1-78、1-87、1-89、1-93、1-94、1-97、1-99、1-100、1-101、1-102、1-103、1-104、1-105、1-106、1-109、1-110、1-112、1-113、1-118、1-120、1-125、1-127、1-128、1-130、1-131、1-133、1-136、1-137、1-138、1-140、1-145、1-148、1-152、1-153、1-156、1-161、1-166、1-167、1-168、1-174、1-178、1-179、1-180、1-

193、1-211、1-213、1-215、1-216、1-223、1-224、1-225、1-234、1-235、1-248、1-249、1-251、1-252、1-263、1-275、1-277、1-291、1-328、1-329、1-330、1-331、1-332、1-333、1-334、1-336、1-340、2-7、2-8、2-31和2-33的化合物在500ppm下表现出A判定的活性,特别是化合物编号1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-15、1-17、1-18、1-54、1-63、1-64、1-65、1-66、1-68、1-69、1-70、1-71、1-87、1-106、1-168、1-211、1-215、1-216、1-223、1-252、1-332、2-31和2-33的化合物在50ppm下表现出A判定的优异活性。

[0468] 试验例2. 针对灰飞虱(*Laodelphax striatellus*)的杀虫试验

[0469] 将本发明的通式(1)表示的化合物或其盐类分散于水中稀释成50ppm或500ppm的药液,将水稻幼苗(品种:日本晴)在该药液中浸渍30秒,风干后放入玻璃试验管,分别接种灰飞虱3龄各10只后,塞上棉栓,接种8天后调查生死虫数,校正死虫率通过下述式计算,根据试验例1的判定基准进行判定。

[0470] [数学式2]

$$[0471] \quad \text{校正死虫率(\%)} = \frac{(\text{无处理区生存率} - \text{处理区生存率})}{(\text{无处理区生存率})} \times 100$$

[0472] 其结果,对于灰飞虱,本发明的通式(1)表示的化合物中,化合物编号1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-12、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-24、1-28、1-29、1-30、1-34、1-35、1-36、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-44、1-53、1-54、1-63、1-64、1-65、1-66、1-67、1-68、1-69、1-70、1-71、1-78、1-87、1-88、1-89、1-90、1-91、1-93、1-94、1-95、1-96、1-97、1-99、1-100、1-101、1-102、1-103、1-104、1-105、1-106、1-109、1-110、1-111、1-112、1-113、1-118、1-119、1-120、1-121、1-122、1-123、1-124、1-125、1-127、1-128、1-129、1-130、1-131、1-133、1-136、1-137、1-138、1-140、1-141、1-142、1-143、1-145、1-148、1-149、1-150、1-151、1-152、1-153、1-156、1-157、1-159、1-161、1-164、1-165、1-166、1-167、1-168、1-174、1-178、1-179、1-180、1-182、1-193、1-196、1-197、1-198、1-200、1-202、1-205、1-206、1-211、1-213、1-215、1-216、1-223、1-224、1-225、1-228、1-234、1-235、1-240、1-248、1-249、1-251、1-252、1-253、1-262、1-263、1-264、1-265、1-267、1-268、1-269、1-271、1-272、1-273、1-275、1-276、1-277、1-278、1-280、1-281、1-282、1-284、1-285、1-291、1-302、1-303、1-306、1-321、1-322、1-328、1-329、1-330、1-331、1-332、1-334、1-335、1-336、1-337、1-338、1-339、1-340、1-341、1-342、1-343、2-7、2-8、2-31、2-33、3-1和3-2的化合物在500ppm下表现出A判定的活性,特别是化合物编号1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-12、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-24、1-28、1-29、1-30、1-34、1-35、1-36、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-44、1-53、1-54、1-63、1-64、1-65、1-66、1-67、1-68、1-69、1-70、1-71、1-78、1-87、1-88、1-89、1-90、1-91、1-93、1-94、1-95、1-97、1-99、1-100、1-101、1-103、1-104、1-105、1-106、1-109、1-110、1-111、1-112、1-113、1-118、1-119、1-120、1-121、1-122、1-123、1-124、1-125、1-127、1-128、1-129、1-130、1-131、1-133、1-136、1-137、1-138、1-140、1-141、1-142、1-143、1-145、1-148、1-149、1-150、1-151、1-152、1-153、1-156、1-157、1-159、1-161、1-164、1-165、1-166、1-167、1-168、1-174、1-178、1-179、1-180、1-182、1-193、1-196、1-197、1-198、1-200、1-202、1-205、1-206、1-211、1-213、1-215、1-216、1-223、1-224、1-225、1-228、1-234、1-235、1-240、1-248、1-249、1-251、1-252、1-253、1-262、1-263、1-

264、1-265、1-267、1-268、1-269、1-271、1-272、1-273、1-275、1-276、1-277、1-278、1-280、1-281、1-282、1-284、1-285、1-291、1-302、1-303、1-306、1-321、1-322、1-328、1-329、1-330、1-331、1-332、1-334、1-335、1-336、1-337、1-338、1-339、1-340、1-341、1-342、1-343、2-7、2-8、2-31、2-33、3-1和3-2的化合物在50ppm下表现出A判定的优异活性。

[0473] 试验例3. 针对西花蓟马(*Frankliniella occidentalis*)的杀虫试验

[0474] 将西花蓟马雌成虫接种至芸豆叶片,使其产卵1天后,除去雌成虫。接着,在3天后,对叶片上的孵化幼虫进行计数后,用以第1表~第4表所述的化合物作为有效成分的药剂稀释至50ppm或500ppm而得到的药液进行了散布。调查处理4天后生存的该物种幼虫数,通过下述式计算校正死虫率,根据试验例1的判定基准而进行。2次重复。

[0475] [数学式3]

无处理区生存率-处理区生存率

$$[0476] \quad \text{校正死虫率(\%)} = \frac{\text{无处理区生存率} - \text{处理区生存率}}{\text{无处理区生存率}} \times 100$$

[0477] 其结果,针对西花蓟马,本发明的通式(1)表示的化合物中,化合物编号1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-12、1-14、1-15、1-18、1-28、1-29、1-30、1-34、1-35、1-36、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-44、1-53、1-54、1-63、1-64、1-65、1-66、1-67、1-68、1-69、1-70、1-71、1-78、1-87、1-88、1-89、1-90、1-91、1-93、1-94、1-96、1-97、1-99、1-100、1-101、1-102、1-103、1-104、1-105、1-106、1-109、1-110、1-111、1-112、1-113、1-118、1-119、1-120、1-122、1-123、1-124、1-125、1-128、1-129、1-130、1-131、1-133、1-136、1-137、1-138、1-140、1-141、1-142、1-143、1-145、1-148、1-149、1-150、1-151、1-152、1-153、1-156、1-157、1-159、1-161、1-164、1-165、1-166、1-167、1-168、1-174、1-178、1-179、1-180、1-193、1-195、1-196、1-197、1-198、1-200、1-207、1-211、1-213、1-215、1-216、1-223、1-224、1-225、1-228、1-234、1-248、1-249、1-251、1-252、1-253、1-262、1-263、1-264、1-267、1-271、1-272、1-273、1-275、1-276、1-277、1-278、1-279、1-280、1-281、1-282、1-284、1-285、1-291、1-294、1-302、1-303、1-306、1-321、1-322、1-328、1-329、1-330、1-332、1-335、1-336、1-337、1-338、1-339、1-340、1-341、1-342、1-343、2-7、2-8、2-31、2-33、3-1和3-2的化合物在500ppm下表现出A判定的活性,特别是化合物编号1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-12、1-14、1-15、1-18、1-28、1-29、1-30、1-34、1-35、1-36、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-44、1-53、1-54、1-63、1-64、1-65、1-66、1-67、1-68、1-69、1-70、1-71、1-78、1-87、1-88、1-89、1-90、1-91、1-93、1-94、1-97、1-99、1-100、1-101、1-102、1-103、1-104、1-105、1-109、1-110、1-111、1-112、1-113、1-118、1-119、1-120、1-122、1-123、1-124、1-125、1-128、1-129、1-130、1-131、1-133、1-136、1-137、1-138、1-140、1-141、1-142、1-143、1-145、1-148、1-149、1-150、1-151、1-152、1-153、1-156、1-157、1-159、1-161、1-164、1-165、1-166、1-167、1-168、1-174、1-178、1-179、1-180、1-193、1-195、1-196、1-197、1-198、1-200、1-207、1-211、1-213、1-215、1-216、1-223、1-224、1-225、1-228、1-234、1-248、1-249、1-251、1-252、1-253、1-262、1-263、1-264、1-267、1-271、1-272、1-273、1-275、1-276、1-277、1-278、1-279、1-280、1-281、1-284、1-285、1-291、1-294、1-302、1-303、1-306、1-321、1-322、1-328、1-329、1-330、1-332、1-335、1-336、1-337、1-338、1-339、1-340、1-341、1-342、1-343、2-7、2-8、2-31、2-33、3-1和3-2的化合物在50ppm下表现出A判定的优异活性。

[0478] 工业实用性

[0479] 本发明的化合物或其盐作为杀虫剂具有优异的效果。