



(12)发明专利申请

(10)申请公布号 CN 110831925 A

(43)申请公布日 2020.02.21

(21)申请号 201880040570.X

(22)申请日 2018.06.22

(30)优先权数据

2017-124485 2017.06.26 JP

2018-083512 2018.04.24 JP

(85)PCT国际申请进入国家阶段日

2019.12.18

(86)PCT国际申请的申请数据

PCT/JP2018/023819 2018.06.22

(87)PCT国际申请的公布数据

W02019/004082 JA 2019.01.03

(71)申请人 日本曹达株式会社

地址 日本东京都

(72)发明人 阪西庆太 青山光 崎山训史

岩佐孝男 牛岛大佑 松井麻记

(74)专利代理机构 北京集佳知识产权代理有限公司 11227

代理人 李书慧 金世煜

(51)Int.Cl.

C07D 213/71(2006.01)

A01N 43/40(2006.01)

A01N 43/54(2006.01)

A01N 43/56(2006.01)

A01N 43/58(2006.01)

A01N 43/647(2006.01)

A01P 7/02(2006.01)

A01P 7/04(2006.01)

C07D 401/04(2006.01)

C07D 401/14(2006.01)

C07D 403/04(2006.01)

C07D 403/14(2006.01)

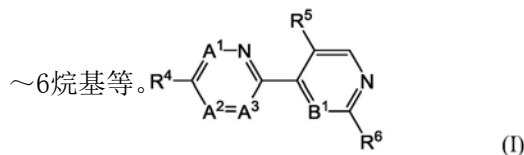
权利要求书1页 说明书48页

(54)发明名称

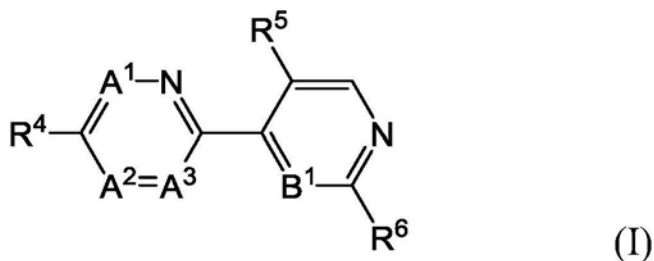
杂芳基嘧啶化合物和有害生物防除剂

(57)摘要

式(I)表示的化合物或其盐。式(I)中, A¹为CR¹或氮原子。A²为CR²或氮原子。A³为CR³或氮原子。其中, A¹~A³中的二个以上不为氮原子。R¹、R²和R³各自独立地为氢原子等。B¹为CH或氮原子。R⁴为取代或无取代的C1~6烷基等。R⁵为取代或无取代的C1~6烷基等。R⁶为取代或无取代的C1



1. 式 (I) 表示的化合物或其盐,



式 (I) 中,

A¹为CR¹或氮原子,

A²为CR²或氮原子,

A³为CR³或氮原子,

其中,A¹~A³中的二个以上不为氮原子,

R¹、R²和R³各自独立地为氢原子、取代或无取代的C1~6烷基、羟基、取代或无取代的C1~6烷氧基、硝基、氰基、取代或无取代的氨基、或者卤素基团,

B¹为CH或氮原子,

R⁴为取代或无取代的C1~6烷基、取代或无取代的C2~6烯基、取代或无取代的C2~6炔基、羟基、取代或无取代的C1~6烷氧基、甲酰基、取代或无取代的C1~6烷基羰基、取代或无取代的C1~6烷氧基羰基、取代或无取代的C1~6烷基硫基、取代或无取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或无取代的C1~6烷基磺酰基、取代或无取代的C1~6烷基磺酰基氧基、取代或无取代的C3~8环烷基、取代或无取代的5~6元杂芳基、取代或无取代的氨基、取代或无取代的氨基羰基、或者-N=CR^aR^b表示的基团,在此,R^a为氢原子或C1~6烷基,R^b为C1~6烷基,

R⁵为取代或无取代的C1~6烷基硫基、取代或无取代的C1~6烷基亚磺酰基、或者取代或无取代的C1~6烷基磺酰基,

R⁶为取代或无取代的C1~6烷基、取代或无取代的C2~6烯基、取代或无取代的C2~6炔基、羟基、取代或无取代的C1~6烷氧基、取代或无取代的C1~6烷氧基羰基、取代或无取代的C1~6烷基硫基、取代或无取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或无取代的C1~6烷基磺酰基、取代或无取代的C3~8环烷基、取代或无取代的C6~10芳基、取代或无取代的5~6元杂芳基、取代或无取代的C6~10芳氧基、取代或无取代的5~6元杂芳氧基、硝基、氰基、取代或无取代的氨基、取代或无取代的氨基羰基、取代或无取代的胍基、卤素基团、-N=CHNR^cR^d表示的基团、或者-N=S(O)_xR^eR^f,在此,R^c、R^d、R^e和R^f为取代或无取代的C1~6烷基,x为0或1。

2. 一种有害生物防除剂,含有选自权利要求1所述的化合物及它们的盐中的至少一个作为有效成分。

3. 一种杀虫或杀螨剂,含有选自权利要求1所述的化合物及它们的盐中的至少一个作为有效成分。

4. 一种体外寄生虫防除剂,含有选自权利要求1所述的化合物及它们的盐中的至少一个作为有效成分。

5. 一种体内寄生虫防除剂或驱除剂,含有选自权利要求1所述的化合物及它们的盐中的至少一个作为有效成分。

杂芳基嘧啶化合物和有害生物防除剂

技术领域

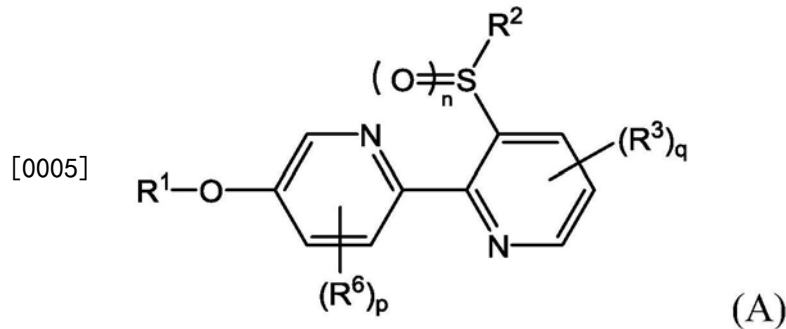
[0001] 本发明涉及杂芳基嘧啶化合物和有害生物防除剂。更详细而言,本发明涉及具有优异的杀虫活性和/或杀螨活性、安全性优异且工业上能够有利地合成的杂芳基嘧啶化合物、以及含有其作为有效成分的有害生物防除剂。

[0002] 本申请基于2017年6月26日在日本申请的日本特愿2017-124485号和2018年4月24日在日本申请的日本特愿2018-083512号主张优先权,并将其内容援引于此。

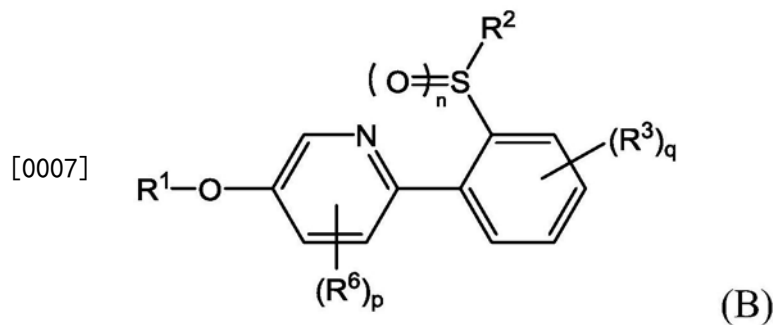
背景技术

[0003] 已经提出了各种具有杀虫·杀螨活性的化合物。为了将这样的化合物作为农药进行实用,要求不仅效力足够高,而且不易产生耐药性,不产生对植物的药害、土壤污染,对家畜、鱼类等的毒性低等。

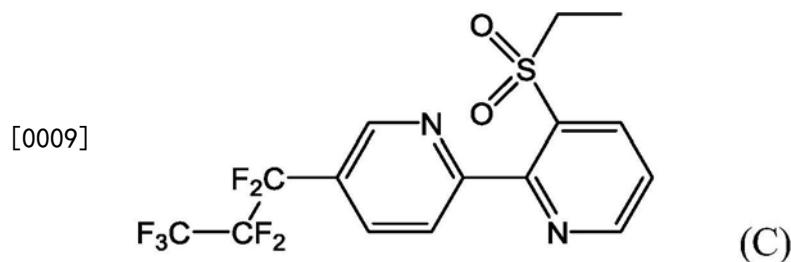
[0004] 于是,专利文献1中公开了式(A)表示的化合物等。



[0006] 专利文献2中公开了式(B)表示的化合物等。



[0008] 专利文献3中公开了式(C)表示的化合物等。



[0010] 现有技术文献

[0011] 专利文献

[0012] 专利文献1:W02016/121969A

[0013] 专利文献2:W02017/069105A

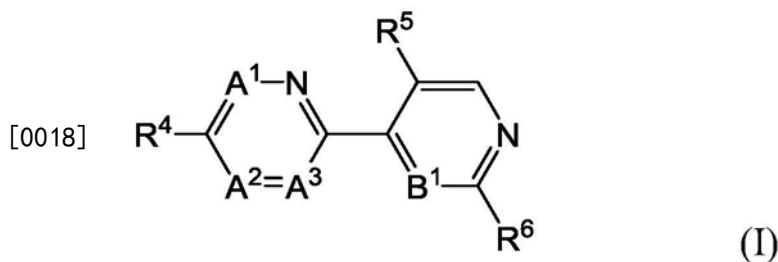
[0014] 专利文献3:W02017/150209A

发明内容

[0015] 本发明的课题在于提供有害生物防除活性、其中尤其是杀虫活性和/或杀螨活性优异、安全性优异且工业上能够有利地合成的杂芳基嘧啶化合物。本发明的其它的课题在于提供含有杂芳基嘧啶化合物作为有效成分的有害生物防除剂、杀虫或杀螨剂、体外寄生虫防除剂、或者体内寄生虫防除或驱除剂。

[0016] 为了解决上述课题而进行了深入的研究,结果完成了包含以下形态的本发明。

[0017] (1)式(I)表示的化合物或其盐。



[0019] 式(I)中,

[0020] A¹为CR¹或氮原子。

[0021] A²为CR²或氮原子。

[0022] A³为CR³或氮原子。

[0023] 其中,A¹~A³中的二个以上不为氮原子。

[0024] R¹、R²和R³各自独立地为氢原子、取代或无取代的C1~6烷基、羟基、取代或无取代的C1~6烷氧基、硝基、氰基、取代或无取代的氨基、或者卤素基团。

[0025] B¹为CH或氮原子。

[0026] R⁴为取代或无取代的C1~6烷基、取代或无取代的C2~6烯基、取代或无取代的C2~6炔基、羟基、取代或无取代的C1~6烷氧基、甲酰基、取代或无取代的C1~6烷基羰基、取代或无取代的C1~6烷氧基羰基、取代或无取代的C1~6烷基硫基、取代或无取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或无取代的C1~6烷基磺酰基、取代或无取代的C1~6烷基磺酰基氧基、取代或无取代的C3~8环烷基、取代或无取代的5~6元杂芳基、取代或无取代的氨基、取代或无取代的氨基羰基、或者-N=CR^aR^b表示的基团。这里,R^a为氢原子或C1~6烷基,R^b为C1~6烷基。

[0027] R⁵为取代或无取代的C1~6烷基硫基、取代或无取代的C1~6烷基亚磺酰基、或者取代或无取代的C1~6烷基磺酰基。

[0028] R⁶为取代或无取代的C1~6烷基、取代或无取代的C2~6烯基、取代或无取代的C2~6炔基、羟基、取代或无取代的C1~6烷氧基、取代或无取代的C1~6烷氧基羰基、取代或无取代的C1~6烷基硫基、取代或无取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或无取代的C1~6烷基磺酰基、取代或无取代的C3~8环烷基、取代或无取代的C6~10芳基、取代或无取代的5~6元杂芳基、取代或无取代的C6~10芳氧基、取代或无取代的5~6元杂芳氧基、硝基、氰基、取代或

无取代的氨基、取代或无取代的氨基羰基、取代或无取代的胍基、卤素基团、 $-N=CHNR^cR^d$ 表示的基团、或者 $-N=S(O)_xR^eR^f$ 。在此, R^c 、 R^d 、 R^e 和 R^f 为取代或无取代的C1~6烷基,x为0或1。

[0029] (2)一种有害生物防除剂,含有选自上述(1)所述的化合物及其盐中的至少一个作为有效成分。

[0030] (3)一种杀虫或杀螨剂,含有选自上述(1)所述的化合物及其盐中的至少一个作为有效成分。

[0031] (4)一种体外寄生虫防除剂,含有选自上述(1)所述的化合物及其盐中的至少一个作为有效成分。

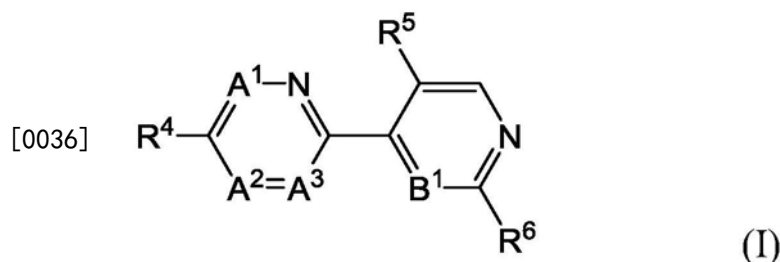
[0032] (5)一种体内寄生虫防除剂或驱除剂,含有选自上述(1)所述的化合物及其盐中的至少一个作为有效成分。

[0033] 本发明的杂芳基嘧啶化合物能够防除在农作物、卫生方面成为问题的有害生物。特别是能够以更低浓度有效地防除农业害虫和螨类。此外,能够有效地防除危害人畜的体外寄生虫和体内寄生虫。

具体实施方式

[0034] (杂芳基嘧啶化合物)

[0035] 本发明的杂芳基嘧啶化合物为式(I)表示的化合物(以下,有时记载为化合物(I))或化合物(I)的盐。



[0037] 本发明中,“无取代(unsubstituted)”的术语表示仅为成为母核的基团。没有“取代”这样的记载而仅用成为母核的基团的名称记载时,只要没有特别说明,就表示“无取代”。

[0038] 另一方面,“取代(substituted)”的术语表示成为母核的基团中的任一氢原子被与母核相同或不同结构的基团(取代基)所取代。因此,“取代基”是与成为母核的基团键合的其它基团。取代基可以为1个,也可以为2个以上。2个以上的取代基可以相同,也可以不同。

[0039] “C1~6”等术语表示成为母核的基团的碳原子数为1~6个等。该碳原子数中不包括取代基中存在的碳原子的个数。例如,具有乙氧基作为取代基的丁基分类为C2烷氧基C4烷基。

[0040] “取代基”只要化学上允许且具有本发明的效果,就没有特别限制。以下,例示可以作为“取代基”的基团。

[0041] 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、正戊基、正己基等C1~6烷基;

[0042] 乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基(烯丙基)、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-

- 甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基等C2~6烯基；
- [0043] 乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基等C2~6炔基；
- [0044] 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、立方烷基 (cubanyl) 等C3~8环烷基；
- [0045] 苯基、萘基等C6~10芳基；
- [0046] 苄基、苄乙基等C6~10芳基C1~6烷基；
- [0047] 3~6元杂环基；
- [0048] 3~6元杂环基C1~6烷基；
- [0049] 羟基；
- [0050] 甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等C1~6烷氧基；
- [0051] 乙烯氧基、烯丙氧基、丙烯氧基、丁烯氧基等C2~6烯氧基；
- [0052] 乙炔氧基、丙炔氧基等C2~6炔氧基；
- [0053] 苯氧基、萘氧基等C6~10芳氧基；
- [0054] 苄氧基、苄乙氧基等C6~10芳基C1~6烷氧基；
- [0055] 噻唑氧基、吡啶氧基等5~6元杂芳氧基；
- [0056] 噻唑基甲氧基、吡啶基甲氧基等5~6元杂芳基C1~6烷氧基；
- [0057] 甲酰基；
- [0058] 乙酰基、丙酰基等C1~6烷基羰基；
- [0059] 甲酰氧基；
- [0060] 乙酰氧基、丙酰氧基等C1~6烷基羰基氧基；
- [0061] 苯甲酰基等C6~10芳基羰基；
- [0062] 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、叔丁氧基羰基等C1~6烷氧羰基；
- [0063] 甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基、正丙氧基羰基氧基、异丙氧基羰基氧基、正丁氧基羰基氧基、叔丁氧基羰基氧基等C1~6烷氧基羰基氧基；
- [0064] 羧基；
- [0065] 氟基、氯基、溴基、碘基等卤素基团；
- [0066] 氯甲基、氯乙基、二氟甲基、三氟甲基、2,2,2-三氟乙基、五氟乙基、1,2-二氯-正丙基、1-氟-正丁基、全氟正戊基等C1~6卤代烷基；
- [0067] 2-氯-1-丙烯基、2-氟-1-丁烯基等C2~6卤代烯基；
- [0068] 4,4-二氯-1-丁炔基、4-氟-1-戊炔基、5-溴-2-戊炔基等C2~6卤代炔基；
- [0069] 三氟甲氧基、2-氯-正丙氧基、2,3-二氯丁氧基等C1~6卤代烷氧基；
- [0070] 2-氯丙烯氧基、3-溴丁烯氧基等C2~6卤代烯氧基；
- [0071] 氯乙酰基、三氟乙酰基、三氯乙酰基等C1~6卤代烷基羰基；
- [0072] 氨基；
- [0073] 甲基氨基、二甲基氨基、二乙基氨基等C1~6烷基取代氨基；
- [0074] 苯胺基、萘基氨基等C6~10芳基氨基；

- [0075] 苜基氨基、苜乙基氨基等C6~10芳基C1~6烷基氨基；
- [0076] 甲酰基氨基；
- [0077] 乙酰基氨基、丙酰基氨基、丁酰基氨基、异丙基羰基氨基等C1~6烷基羰基氨基；
- [0078] 甲氧基羰基氨基、乙氧基羰基氨基、正丙氧基羰基氨基、异丙氧基羰基氨基等C1~6烷氧基羰基氨基；
- [0079] 氨基羰基、二甲基氨基羰基、苜基氨基羰基、N-苜基-N-甲基氨基羰基等无取代或具有取代基的氨基羰基；
- [0080] 亚氨基甲基、(1-亚氨基)乙基、(1-亚氨基)-正丙基等亚氨基C1~6烷基；
- [0081] N-羟基-亚氨基甲基、(1-(N-羟基)-亚氨基)乙基、(1-(N-羟基)-亚氨基)丙基、N-甲氧基-亚氨基甲基、(1-(N-甲氧基)-亚氨基)乙基等取代或无取代的N-羟基亚氨基C1~6烷基；
- [0082] 氨基羰基氧基；
- [0083] 乙基氨基羰基氧基、二甲基氨基羰基氧基等C1~6烷基取代氨基羰基氧基；
- [0084] 硫基；
- [0085] 甲基硫基、乙基硫基、正丙基硫基、异丙基硫基、正丁基硫基、异丁基硫基、仲丁基硫基、叔丁基硫基等C1~6烷基硫基；
- [0086] 三氟甲基硫基、2,2,2-三氟乙基硫基等C1~6卤代烷基硫基；
- [0087] 苜基硫基、萘基硫基等C6~10芳基硫基；
- [0088] 噻唑基硫基、吡啶基硫基等5~6元杂芳基硫基；
- [0089] 甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、叔丁基亚磺酰基等C1~6烷基亚磺酰基；
- [0090] 三氟甲基亚磺酰基、2,2,2-三氟乙基亚磺酰基等C1~6卤代烷基亚磺酰基；
- [0091] 苜基亚磺酰基等C6~10芳基亚磺酰基；
- [0092] 噻唑基亚磺酰基、吡啶基亚磺酰基等5~6元杂芳基亚磺酰基；
- [0093] 甲基磺酰基、乙基磺酰基、叔丁基磺酰基等C1~6烷基磺酰基；
- [0094] 三氟甲基磺酰基、2,2,2-三氟乙基磺酰基等C1~6卤代烷基磺酰基；
- [0095] 苜基磺酰基等C6~10芳基磺酰基；
- [0096] 噻唑基磺酰基、吡啶基磺酰基等5~6元杂芳基磺酰基；
- [0097] 甲基磺酰基氧基、乙基磺酰基氧基、叔丁基磺酰基氧基等C1~6烷基磺酰基氧基；
- [0098] 三氟甲基磺酰基氧基、2,2,2-三氟乙基磺酰基氧基等C1~6卤代烷基磺酰基氧基；
- [0099] 三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基等三C1~6烷基取代甲硅烷基；
- [0100] 三苜基甲硅烷基等三C6~10芳基取代甲硅烷基；
- [0101] 氰基；硝基；
- [0102] 另外，对于这些“取代基”，上述取代基中的任一氢原子可以被不同结构的基团所取代。作为该情况下的“取代基”，可以举出C1~6烷基、C1~6卤代烷基、C1~6烷氧基、C1~6卤代烷氧基、卤素基团、氰基、硝基等。
- [0103] 另外，上述的“3~6元杂环基”是指包含选自氮原子、氧原子和硫原子中的1~4个杂原子作为环的构成原子。杂环基可以为单环和多环中的任一种。多环杂环基只要至少一

个环为杂环,则其余的环可以为饱和脂环、不饱和脂环或芳香环中的任一种。作为“3~6元杂环基”,可举出3~6元饱和杂环基、5~6元杂芳基、5~6元部分不饱和杂环基等。

[0104] 作为3~6元饱和杂环基,可举出氮丙啶基、环氧基、吡咯烷基、四氢呋喃基、噻唑烷基、哌啶基、哌嗪基、吗啉基、二氧戊环基、二噁烷基等。

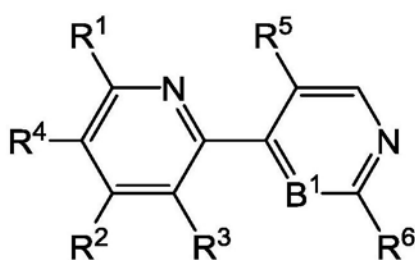
[0105] 作为5元杂芳基,可举出吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等。

[0106] 作为6元杂芳基,可举出吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等。

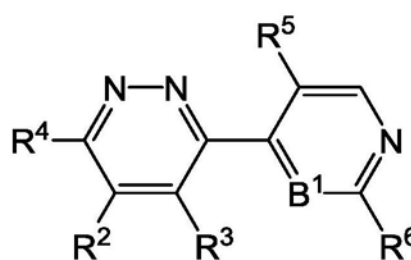
[0107] (A^1, A^2, A^3)

[0108] 式(I)中, A^1 为 CR^1 或氮原子, A^2 为 CR^2 或氮原子, A^3 为 CR^3 或氮原子。其中, $A^1 \sim A^3$ 中的二个以上不为氮原子。

[0109] 即,式(I)表示的化合物为式(II)~式(V)表示的化合物。

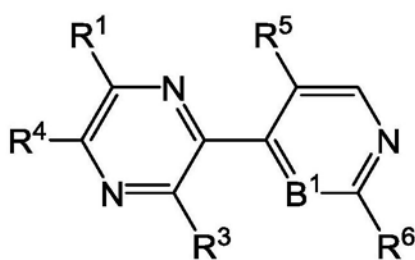


(II)

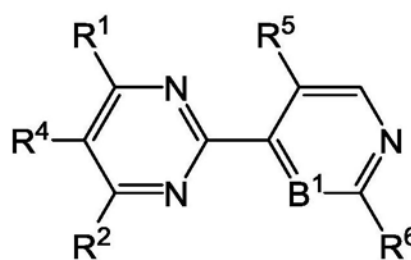


(III)

[0110]



(IV)



(V)

[0111] 式(II)~式(V)中, B^1, R^4, R^5 和 R^6 是与式(I)中的 B^1, R^4, R^5 和 R^6 相同的含义。式(I)表示的化合物优选为式(II)或式(III)表示的化合物。

[0112] R^1, R^2 和 R^3 各自独立地为氢原子、取代或无取代的C1~6烷基、羟基、取代或无取代的C1~6烷氧基、硝基、氰基、取代或无取代的氨基、或者卤素基团。

[0113] 作为 R^1, R^2 和 R^3 中的“C1~6烷基”,可以为直链,如果碳原子数为3以上也可以为支链。作为烷基,可以举出甲基、乙基、正丙基、正丁基、正戊基、正己基、异丙基、异丁基、仲丁基、叔丁基、异戊基、新戊基、2-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、异己基等。

[0114] 作为 R^1, R^2 和 R^3 中的“C1~6烷氧基”,可举出甲氧基、乙氧基、正丙氧基、正丁氧基、正戊氧基、正己氧基、异丙氧基、异丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、异己氧基等。

[0115] 作为 R^1, R^2 和 R^3 中的“C1~6烷基”和“C1~6烷氧基”上的优选的取代基,可举出甲氧基,乙氧基,正丙氧基,正丁氧基,正戊氧基,正己氧基,异丙氧基,异丁氧基,仲丁氧基,叔丁氧基,异己氧基等C1~6烷氧基;氟基,氯基,溴基,碘基等卤素基团;氰基;环丙基,环丁基,环戊基,环己基,立方烷基等C3~8环烷基;苯基,萘基等C6~10芳基;吡咯基、呋喃基、噻吩

基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基、吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等5~6元杂芳基等。

[0116] 作为 R^1 、 R^2 和 R^3 中的“取代或无取代的氨基”，为以“ $-NR^gR^h$ ”表示的基团。式中， R^g 和 R^h 各自独立地为氢原子、C1~6烷基、甲酰基、C1~6烷基羰基、C1~6卤代烷基羰基、C3~8环烷基羰基、C1~6烷氧基羰基、取代或无取代的脞基、取代或无取代的氨基羰基、取代或无取代的氨基磺酰基、或者C1~6卤代烷基磺酰基。

[0117] 作为 R^g 和 R^h 中的“C1~6烷基”，可举出与在上述 R^1 、 R^2 和 R^3 中例示的基团相同的基团。

[0118] 作为 R^g 和 R^h 中的“C1~6烷基羰基”，可以举出乙酰基、丙酰基、异丁酰基等。

[0119] 作为 R^g 和 R^h 中的“C1~6卤代烷基羰基”，可以举出三氟乙酰基等。

[0120] 作为 R^g 和 R^h 中的“C3~8环烷基羰基”，可以举出环丙基羰基、环丁基羰基、环戊基羰基、环己基羰基等。

[0121] 作为 R^g 和 R^h 中的“C1~6烷氧基羰基”，可以举出甲氧羰基、乙氧羰基、正丙氧羰基、异丙氧羰基、正丁氧羰基、叔丁氧羰基等。

[0122] 作为 R^g 和 R^h 中的“脞基”上的取代基，可以优选举出甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、正戊基、正己基等C1~6烷基；甲酰基；乙酰基、丙酰基等C1~6烷基羰基；甲氧羰基、乙氧羰基、正丙氧羰基、异丙氧羰基、正丁氧羰基、叔丁氧羰基等C1~6烷氧基羰基。

[0123] 作为 R^g 和 R^h 中的“取代或无取代的氨基羰基”，可以举出氨基羰基、甲氨基羰基、乙氨基羰基、二甲氨基羰基等。

[0124] 作为 R^g 和 R^h 中的“取代或无取代的氨基磺酰基”，可以举出氨基磺酰基、甲氨基磺酰基、二甲氨基磺酰基等。

[0125] R^g 优选为氢原子、C1~6烷基、C1~6烷基羰基、C3~8环烷基羰基、或者取代或无取代的氨基羰基。

[0126] 作为 R^g 和 R^h 中的“C1~6卤代烷基磺酰基”，可以举出三氟甲基磺酰基等。

[0127] R^h 优选为氢原子或C1~6烷基。

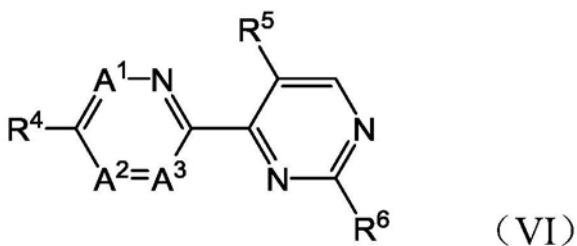
[0128] 作为 R^1 、 R^2 和 R^3 中的“卤素基团”，可举出氟基、氯基、溴基、碘基等。

[0129] R^1 、 R^2 和 R^3 优选为氢原子。

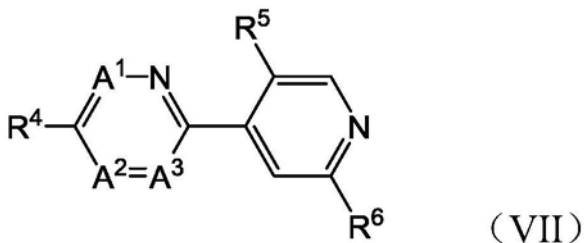
[0130] (B^1)

[0131] 式(I)中， B^1 为CH或氮原子。

[0132] 即，式(I)表示的化合物为式(VI)~式(VII)表示的化合物。



[0133]



[0134] 式(VI)~式(VII)中, A^1 、 A^2 、 A^3 、 R^4 、 R^5 和 R^6 是与式(I)中的 A^1 、 A^2 、 A^3 、 R^4 、 R^5 和 R^6 相同的含义。

[0135] B^1 优选为氮原子。

[0136] (R^4)

[0137] 式(I)中, R^4 为取代或无取代的C1~6烷基、取代或无取代的C2~6烯基、取代或无取代的C2~6炔基、羟基、取代或无取代的C1~6烷氧基、甲酰基、取代或无取代的C1~6烷基羰基、取代或无取代的C1~6烷氧基羰基、取代或无取代的C1~6烷基硫基、取代或无取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或无取代的C1~6烷基磺酰基、取代或无取代的C1~6烷基磺酰基氧基、取代或无取代的C3~8环烷基、取代或无取代的5~6元杂芳基、取代或无取代的氨基、取代或无取代的氨基羰基、或者 $-N=CR^aR^b$ 表示的基团。这里, R^a 为氢原子或C1~6烷基, R^b 为C1~6烷基。

[0138] 作为 R^4 中的“C1~6烷基”、“C1~6烷氧基”和“取代或无取代的氨基”,可举出与在上述 R^1 、 R^2 和 R^3 中例示的基团相同的基团。

[0139] 作为 R^4 中的“C1~6烷基羰基”和“C1~6烷氧基羰基”,可举出与在上述 R^g 和 R^h 中例示的基团相同的基团。

[0140] 作为 R^4 中的“取代C1~6烷基”的具体例,可举出氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、2,2,2-三氟乙基、五氟乙基、3,3,3-三氟丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、全氟丙基、2,2,2-三氟-1-三氟甲基乙基、全氟异丙基、4-氟丁基、2,2,3,3,4,4,4-七氟丁基、全氟丁基、全氟戊基、全氟己基、氯甲基、溴甲基、二氯甲基、二溴甲基、三氯甲基、三溴甲基、1-氯乙基、2,2,2-三氯乙基、4-氯丁基、全氯己基、2,4,6-三氯己基等C1~6卤代烷基;2,2,3,3,3-五氟丙氧基亚氨基甲基、2,2,3,3,4,4,4-七氟丁氧基亚氨基甲基等C1~6卤代烷氧基亚氨基C1~6烷基;等。

[0141] 作为 R^4 中的“取代C1~6烷氧基”的具体例,可举出氯甲氧基、二氯甲氧基、二氟甲氧基、三氯甲氧基、三氟甲氧基、1-氟乙氧基、1,1-二氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、五氟乙氧基、2,2,3,3-四氟丙氧基、2,2,3,3,3-五氟丙氧基、2,2,3,4,4,4-六氟丁氧基、2,2,3,3,4,4,4-七氟丁氧基、2,2,3,3,4,4,5,5-八氟戊氧基等C1~6卤代烷氧基;苄氧基、苄乙氧基等C6~10芳基C1~6烷氧基;环丙基甲氧基等C3~8环烷基C1~

6烷氧基;等。

[0142] 作为 R^4 中的“C2~6烯基”,可举出乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基等。

[0143] 作为 R^4 中的“C2~6炔基”,可举出乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、2-甲基-3-丁炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、2-甲基-3-戊炔基、1-己炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基等。

[0144] 作为“取代C2~6炔基”的具体例,可举出4,4-二氯-1-丁炔基、4-氟-1-戊炔基、5-溴-2-戊炔基等C2~6卤代炔基等。

[0145] 作为 R^4 中的“C1~6烷硫基”,可举出甲硫基、乙硫基、正丙硫基、正丁硫基、正戊硫基、正己硫基、异丙硫基、异丁硫基等。

[0146] 作为 R^4 中的“C1~6烷基亚磺酰基”,可举出甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、叔丁基亚磺酰基等。

[0147] 作为 R^4 中的“C1~6烷基磺酰基”,可举出甲基磺酰基、乙基磺酰基、叔丁基磺酰基等。

[0148] 作为 R^4 中的“C1~6烷基磺酰基氧基”,可举出甲基磺酰氧基、乙基磺酰氧基等。

[0149] 作为 R^4 中的“C1~6烷基”、“C2~6烯基”、“C2~6炔基”、“C1~6烷氧基”、“C1~6烷基羰基”、“C1~6烷氧基羰基”、“C1~6烷硫基”、“C1~6烷基亚磺酰基”、“C1~6烷基磺酰基”和“C1~6烷基磺酰基氧基”上的优选的取代基,可举出氟基、氯基、溴基、碘基等卤素基团;环丙基、环丁基、环戊基、环己基、立方烷基等C3~8环烷基;苯基;2,2,3,3,3-五氟丙氧基亚氨基、2,2,3,3,4,4,4-七氟丁氧基亚氨基等C1~6卤代烷氧基亚氨基;可更优选举出氟基、氯基、溴基、碘基等卤素基团。

[0150] 作为 R^4 中的“C3~8环烷基”,可举出环丙基、环丁基、环戊基、环己基、立方烷基等。

[0151] 作为 R^4 中的“5~6元杂芳基”,可举出吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基(详细而言,为[1,2,3]三唑基或[1,2,4]三唑基)、噁二唑基(详细而言,为[1,2,4]噁二唑基或[1,3,4]噁二唑基)、噻二唑基、四唑基等5元杂芳基;吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等6元杂芳基等。

[0152] 作为 R^4 中的“C3~8环烷基”和“5~6元杂芳基”上的优选的取代基,可举出氟基、氯基、溴基、碘基等卤素基团;氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、2,2,2-三氟乙基、五氟乙基、3,3,3-三氟丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、全氟丙基、2,2,2-三氟-1-三氟甲基乙基、全氟异丙基、4-氟丁基、2,2,3,3,4,4,4-七氟丁基、全氟丁基、全氟戊基、全氟己基、氯甲基、溴甲基、二氯甲基、二溴甲基、三氯甲基、三溴甲基、1-氯乙基、2,2,2-三氯乙基、4-氯丁基、全氯己基、2,4,6-三氯己基等C1~6卤代烷基;乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基等C2~6烯基。

[0153] 作为 R^4 中的“取代或无取代的氨基羰基”,可举出与在 R^s 和 R^h 中例示的基团相同的

基团。

[0154] 作为以“ $-N=CR^aR^b$ ”表示的基团中的 R^a 和 R^b 中的“C1~6烷基”,可举出与在上述 R^1 、 R^2 和 R^3 中例示的基团相同的基团。

[0155] R^4 优选取代或无取代的C1~6烷基、或者取代或无取代的C1~6烷氧基,更优选C1~6卤代烷基、C1~6烷氧基、C1~6卤代烷氧基。

[0156] (R^5)

[0157] 式(I)中, R^5 为取代或无取代的C1~6烷硫基、取代或无取代的C1~6烷基亚磺酰基、或者取代或无取代的C1~6烷基磺酰基。

[0158] R^5 中的“取代或无取代的C1~6烷硫基”、“取代或无取代的C1~6烷基亚磺酰基”和“取代或无取代的C1~6烷基磺酰基”可举出与在上述 R^4 中例示的基团相同的基团。

[0159] R^5 优选C1~6烷基亚磺酰基或C1~6烷基磺酰基,特别优选C1~6烷基磺酰基。

[0160] (R^6)

[0161] 式(I)中, R^6 为取代或无取代的C1~6烷基、取代或无取代的C2~6烯基、取代或无取代的C2~6炔基、羟基、取代或无取代的C1~6烷氧基、取代或无取代的C1~6烷氧基羰基、取代或无取代的C1~6烷硫基、取代或无取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或无取代的C1~6烷基磺酰基、取代或无取代的C3~8环烷基、取代或无取代的C6~10芳基、取代或无取代的5~6元杂芳基、取代或无取代的C6~10芳氧基、取代或无取代的5~6元杂芳氧基、硝基、氰基、取代或无取代的氨基、取代或无取代的氨基羰基、取代或无取代的胍基、卤素基团、 $-N=CHNR^cR^d$ 表示的基团、或者 $-N=S(O)_xR^eR^f$ 。这里, R^c 、 R^d 、 R^e 和 R^f 为取代或无取代的C1~6烷基, x 为0或1。

[0162] 作为 R^6 中的“C1~6烷基”、“C1~6烷氧基”、“取代或无取代的氨基”和“卤素基团”,可举出与在上述 R^1 、 R^2 和 R^3 中例示的基团相同的基团。

[0163] 作为 R^6 中的“C1~6烷氧基羰基”和“取代或无取代的氨基羰基”,可举出与在上述 R^5 和 R^h 中例示的基团相同的基团。

[0164] 作为 R^6 中的“C2~6烯基”、“C2~6炔基”、“C1~6烷硫基”、“C1~6烷基亚磺酰基”、“C1~6烷基磺酰基”、“C3~8环烷基”和“5~6元杂芳基”,可举出与在上述 R^4 中例示的基团相同的基团。

[0165] 作为 R^6 中的“C1~6烷基”、“C2~6烯基”、“C2~6炔基”、“C1~6烷氧基羰基”、“C1~6烷硫基”、“C1~6烷基亚磺酰基”、“C1~6烷基磺酰基”上的优选的取代基,可举出氟基、氯基、溴基、碘基等卤素基团;环丙基、环丁基、环戊基、环己基、立方烷基等C3~8环烷基。

[0166] 作为 R^6 中的“C6~10芳基”,可举出苯基、萘基等。

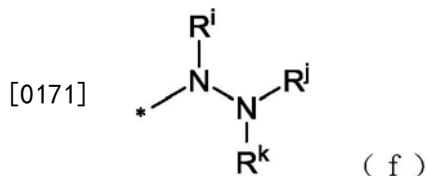
[0167] 作为 R^6 中的“C6~10芳氧基”,可以举出苯氧基、萘氧基、萹氧基、茛氧基、茛满氧基、四氢萘氧基等。

[0168] 作为 R^6 中的“5~6元杂芳氧基”,可以举出噻唑氧基、吡啶氧基等。

[0169] 作为 R^6 中的“C3~8环烷基”、“C6~10芳基”、“杂芳基”、“C6~10芳氧基”和“5~6元杂芳氧基”上的优选的取代基,可以举出氟基、氯基、溴基、碘基等卤素基团;甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、正戊基、正己基等C1~6烷基;氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、2,2,2-三氟乙基、五氟乙基、3,3,3-三氟丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、全氟丙基、2,2,2-三氟-1-三氟甲基乙基、全氟异丙基、4-氟丁基、2,2,3,3,4,4,4-七氟

丁基、全氟丁基、全氟戊基、全氟己基、氯甲基、溴甲基、二氯甲基、二溴甲基、三氯甲基、三溴甲基、1-氯乙基、2,2,2-三氯乙基、4-氯丁基、全氯己基、2,4,6-三氯己基等C1~6卤代烷基；甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等C1~6烷氧基；2-氯-正丙氧基、2,3-二氯丁氧基、三氟甲氧基等C1~6卤代烷氧基；环丙基甲基等C3~8环烷基C1~6烷基；乙酰基、丙酰基等C1~6烷基羰基；氨基；氰基；(2-(三甲基硅烷基)乙氧基)甲基，作为更优选的取代基，可以举出卤素基团、C1~6烷基、C1~6卤代烷基、氨基。

[0170] 作为R⁶中的“取代或无取代的胍基”，为式(f)表示的基团。



[0172] 式(f)中，*为键合位置，Rⁱ、R^j和R^k各自独立地为氢原子、C1~6烷基、或者取代或无取代的苯磺酰基。

[0173] 作为Rⁱ、R^j和R^k中的“C1~6烷基”，可举出与在上述R¹、R²和R³中例示的基团相同的基团。

[0174] 作为Rⁱ、R^j和R^k中的“取代苯磺酰基”，可以举出对甲苯磺酰基等。

[0175] Rⁱ优选为氢原子或C1~6烷基。

[0176] R^j和R^k优选为氢原子。

[0177] 作为以“-N=CHNR^cR^d”表示的基团中的R^c和R^d中的“C1~6烷基”，可举出与在上述R¹、R²和R³中例示的基团相同的基团。

[0178] 作为以“-N=S(O)_xR^eR^f”表示的基团中的R^e和R^f中的“C1~6烷基”，可举出与在上述R¹、R²和R³中例示的基团相同的基团。

[0179] R⁶优选为取代或无取代的C1~6烷基、取代或无取代的C1~6烷氧基、取代或无取代的C6~10芳基、取代或无取代的5~6元杂芳基、氰基、取代或无取代的氨基、或者取代或无取代的胍基，更优选为C1~6烷基、C1~6烷氧基、取代或无取代的苯基、取代或无取代的5~6元杂芳基、氰基、取代或无取代的氨基、或者取代或无取代的胍基。

[0180] 化合物(I)的盐只要是农业园艺学允许的盐，就没有特别限制。作为化合物(I)的盐，例如可举出盐酸、硫酸等无机酸的盐；乙酸、乳酸等有机酸的盐；锂、钠、钾等碱金属的盐；钙、镁等碱土金属的盐；铁、铜等过渡金属的盐；氨、三乙胺、三丁胺、吡啶、胍等有机碱的盐等。

[0181] 化合物(I)或化合物(I)的盐不受其制造方法特别限定。例如，本发明的化合物(I)或化合物(I)的盐可以按照实施例等中记载的公知的制造方法而得到。另外，化合物(I)的盐可以由化合物(I)按照公知的方法而得到。

[0182] 式(I)表示的化合物优选为式(VI)表示的化合物。

[0183] 式(VI)中，A²优选为CR²，A³优选为CR³，R⁴优选为取代或无取代的C1~6烷基、或者取代或无取代的C1~6烷氧基，R⁵优选为烷基磺酰基，R⁶优选为C1~6烷基、C1~6烷氧基、取代或无取代的苯基、取代或无取代的5~6元杂芳基、氰基、取代或无取代的氨基、或者取代或无取代的胍基。

[0184] 式(I)表示的化合物优选为式(VII)表示的化合物。

[0185] 式(VII)中, A^1 优选为 CR^1 , A^2 优选为 CR^2 , A^3 优选为 CR^3 , R^4 优选为取代或无取代的C1~6烷氧基, R^5 优选为烷基磺酰基, R^6 优选为C1~6烷氧基。

[0186] 本发明的杂芳基嘧啶化合物对影响植物生长的各种农业害虫和螨类等有害生物的防除效果优异。

[0187] 另外,本发明的杂芳基嘧啶化合物对农作物的药害少,对鱼类、温血动物的毒性低,因此是一种安全性高的物质。因此,作为杀虫剂或杀螨剂的有效成分是有用的。

[0188] 此外,近年来,在小菜蛾、稻飞虱、叶蝉、蚜虫等许多害虫中发展出对各种现有农药的抗性,产生这些药剂的效力不足的问题,期待对抗性品系的害虫也有有效的药剂。本发明的杂芳基嘧啶化合物不仅对敏感品系表现出优异的防除效果,而且对各种抗性品系的害虫以及杀螨剂抗性品系的螨类也表现出优异的防除效果。

[0189] 本发明的杂芳基嘧啶化合物对危害人畜的体外寄生虫和体内寄生虫的防除效果优异。另外,对鱼类、温血动物的毒性低,因此是一种安全性高的物质。因此,作为体外寄生虫和体内寄生虫的防除剂的有效成分是有用的。

[0190] 另外,本发明的杂芳基嘧啶化合物在作为防除对象的生物体的整个发育阶段显示效力,例如,对螨、昆虫等的卵、若虫、幼虫、蛹、成虫显示优异的防除效果。

[0191] (有害生物防除剂)

[0192] 本发明的有害生物防除剂含有选自本发明的杂芳基嘧啶化合物中的至少一个作为有效成分。本发明的有害生物防除剂中含有的杂芳基嘧啶化合物的量只要表现出有害生物的防除效果就没有特别限制。有害生物防除剂是防除有害生物的药剂,包含杀虫或杀螨剂、体外寄生虫防除剂、或者体内寄生虫防除或驱除剂等。

[0193] (杀虫或杀螨剂)

[0194] 本发明的杀虫或杀螨剂含有选自本发明的杂芳基嘧啶化合物中的至少一个作为有效成分。本发明的杀虫或杀螨剂中含有的杂芳基嘧啶化合物的量只要表现出杀虫或杀螨效果就没有特别限制。

[0195] 本发明的有害生物防除剂、或者杀虫或杀螨剂优选用于谷物类;蔬菜类;根菜类;球茎类;花卉类;果树类;观叶植物、茶、咖啡、可可树等树木类;牧草类;禾本类;棉花等植物。

[0196] 在对植物施用,本发明的有害生物防除剂、或者杀虫或杀螨剂可以用于叶、茎、柄、花、蕾、果实、种子、芽、根、块茎、块根、幼苗、插条等任意部位。

[0197] 另外,本发明的有害生物防除剂、或者杀虫或杀螨剂不受所施用的植物的品种特别限制。作为植物的品种,例如可举出原种、变种、改良品种、栽培品种、突变体、杂交体、转基因体(GMO)等。

[0198] 本发明的有害生物防除剂可以用于种子处理、茎叶散布、土壤施用、水面施用等以防除各种农业害虫和螨类。

[0199] 以下示出可以由本发明的有害生物防除剂防除的各种农业害虫和螨类的具体例。

[0200] (1) 鳞翅目(Lepidoptera)的蝶或蛾

[0201] (a) 灯蛾科(Arctiidae)的蛾:例如,美国白蛾(*Hyphantria cunea*)、奇特望灯蛾(*Lemyra imparilis*);

- [0202] (b) 稜巢蛾科 (*Bucculatricidae*) 的蛾: 例如, 梨角折蛾 (*Bucculatrix pyrivorella*);
- [0203] (c) 蛀果蛾科 (*Carposinidae*): 例如, 桃蛀果蛾 (*Carposina sasakii*);
- [0204] (d) 草螟科 (*Crambidae*) 的蛾: 例如, 绢野螟属 (*Diaphania* spp.) 的瓜绢野螟 (*Diaphania indica*)、黄瓜绢野螟 (*Diaphania nitidalis*); 例如, 秆野螟属 (*Ostrinia* spp.) 的亚洲玉米螟 (*Ostrinia furnacalis*)、欧洲玉米螟 (*Ostrinia nubilalis*)、麻田豆秆野螟 (*Ostrinia scapulalis*); 以及二化螟 (*Chilo suppressalis*)、稻纵卷叶螟 (*Cnaphalocrocis medinalis*)、桃蛀螟 (*Conogethes punctiferalis*)、西南玉米螟 (*Diatraea grandiosella*)、桑绢野螟 (*Glyphodes pyloalis*)、菜螟 (*Hellula undalis*)、早熟禾拟茎草螟 (*Parapediasia teterrella*);
- [0205] (e) 麦蛾科 (*Gelechiidae*) 的蛾: 例如, 甘薯麦蛾 (*Helcystogramma triannulella*)、棉红铃虫 (*Pectinophora gossypiella*)、马铃薯块茎蛾 (*Phthorimaea operculella*)、麦蛾 (*Sitotroga cerealella*);
- [0206] (f) 尺蛾科 (*Geometridae*) 的蛾: 例如, 大造桥虫 (*Ascotis selenaria*);
- [0207] (g) 细蛾科 (*Gracillariidae*) 的蛾: 例如, 茶细蛾 (*Caloptilia theivora*)、柑桔潜叶蛾 (*Phyllocnistis citrella*)、金纹细蛾 (*Phyllonorycter ringoniella*);
- [0208] (h) 弄蝶科 (*Hesperiidae*) 的蝶: 例如, 直纹稻弄蝶 (*Parnara guttata*);
- [0209] (i) 枯叶蛾科 (*Lasiocampidae*) 的蛾: 例如, 天幕毛虫 (*Malacosoma neustria*);
- [0210] (j) 毒蛾科 (*Lymantriidae*) 的蛾: 例如, 毒蛾属 (*Lymantria* spp.) 的舞毒蛾 (*Lymantria dispar*)、模毒蛾 (*Lymantria monacha*); 其它的茶毛虫 (*Euproctis pseudoconsersa*)、旋古毒蛾 (*Orgyia thyellina*);
- [0211] (k) 潜蛾科 (*Lyonetiidae*) 的蛾: 例如, 潜蛾属 (*Lyonetia* spp.) 的桃潜叶蛾 (*Lyonetia clerkella*)、银纹潜叶蛾 (*Lyonetia prunifoliella malinella*);
- [0212] (l) 夜蛾科 (*Noctuidae*) 的蛾: 例如, 灰翅夜蛾属 (*Spodoptera* spp.) 的淡剑袭夜蛾 (*Spodoptera depravata*)、南部灰翅夜蛾 (*Spodoptera eridania*)、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua*)、草地夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*)、非洲棉叶虫蛾 (*Spodoptera littoralis*)、斜纹夜蛾 (*Spodoptera litura*); 例如, 丫纹夜蛾属 (*Autographa* spp.) 的银纹夜蛾 (*Autographa gamma*)、黑点丫纹夜蛾 (*Autographa nigrisigna*); 例如, 地夜蛾属 (*Agrotis* spp.) 的小地老虎 (*Agrotis ipsilon*)、芜菁夜蛾 (*Agrotis segetum*); 例如, 铃夜蛾属 (*Helicoverpa* spp.) 的棉铃虫 (*Helicoverpa armigera*)、烟夜蛾 (*Helicoverpa assulta*)、谷实夜蛾 (*Helicoverpa zea*); 例如, 实夜蛾属 (*Heliothis* spp.) 的棉铃虫 (*Heliothis armigera*)、烟芽夜蛾 (*Heliothis virescens*); 其它的白斑烦夜蛾 (*Aedia leucomelas*)、银纹夜蛾 (*Ctenoplusia agnata*)、枯叶夜蛾 (*Eudocima tyrannus*)、甘蓝夜蛾 (*Mamestra brassicae*)、粘虫 (*Mythimna separata*)、稻螟蛉 (*Naranga aenescens*)、松切蛾 (*Panolis japonica*)、疆夜蛾 (*Peridroma saucia*)、大豆夜蛾 (*Pseudoplusia includens*)、粉纹夜蛾 (*Trichoplusia ni*);
- [0213] (m) 瘤蛾科 (*Nolidae*) 的蛾: 例如, 棉斑实蛾 (*Earias insulana*);
- [0214] (n) 粉蝶科 (*Pieridae*) 的蝶: 例如, 粉蝶属 (*Pieris* spp.) 的欧洲粉蝶 (*Pieris brassicae*)、纹白蝶 (*Pieris rapae crucivora*);

[0215] (o) 菜蛾科 (Plutellidae) 的蛾:例如,葱菜蛾属 (*Acrolepiopsis* spp.) 的葱菜蛾 (*Acrolepiopsis sapporensis*)、铃木伪菜蛾 (*Acrolepiopsis suzukiella*);以及小菜蛾 (*Plutella xylostella*);

[0216] (p) 螟蛾科 (Pyralidae) 的蛾:例如,粉斑螟蛾 (*Cadra cautella*)、小玉米茎蛀虫 (*Elasmopalpus lignosellus*)、豆荚斑螟 (*Etiella zinckenella*)、大蜡螟 (*Galleria mellonella*);

[0217] (q) 天蛾科 (Sphingidae) 的蛾:例如,天蛾属 (*Manduca* spp.) 的番茄天蛾 (*Manduca quinquemaculata*)、烟草天蛾 (*Manduca sexta*);

[0218] (r) 举肢蛾科 (Stathmopodidae) 的蛾:例如,柿举肢蛾 (*Stathmopoda masinissa*);

[0219] (s) 谷蛾科 (Tineidae) 的蛾:例如,衣蛾 (*Tinea translucens*);

[0220] (t) 卷蛾科 (Tortricidae) 的蛾:例如,褐带卷蛾属 (*Adoxophyes* spp.) 的茶小卷叶蛾 (*Adoxophyes honmai*)、苹小卷叶蛾 (*Adoxophyes orana*);例如,黄卷蛾属 (*Archips* spp.) 的梨黄卷蛾 (*Archips breviplicanus*)、苹果黄卷蛾 (*Archips fuscocupreanus*);其它的云杉芽卷蛾 (*Choristoneura fumiferana*)、苹果蠹蛾 (*Cydia pomonella*)、女贞细卷蛾 (*Eupoecilia ambiguella*)、梨小食心虫 (*Grapholitha molesta*)、后黄卷叶蛾 (*Homona magnanima*)、大豆食心虫 (*Leguminivora glycinivorella*)、葡萄花翅小卷蛾 (*Lobesia botrana*)、豆小卷叶蛾 (*Matsumuraeses phaseoli*)、苹褐卷蛾 (*Pandemis heparana*)、葡萄长须卷叶蛾 (*Sparganothis pilleriana*);

[0221] (u) 巢蛾科 (Yponomeutidae) 的蛾:例如,苹果银蛾 (*Argyresthia conjugella*)。

[0222] (2) 缨翅目 (Thysanoptera) 害虫

[0223] (a) 管蓟马科 (Phlaeothripidae) 的:例如,柿管蓟马 (*Ponticulothrips diospyrosi*);

[0224] (b) 蓟马科 (Thripidae) 的:例如,花蓟马属 (*Frankliniella* spp.) 的水稻花蓟马 (*Frankliniella intonsa*)、西花蓟马 (*Frankliniella occidentalis*);例如,蓟马属 (*Thrips* spp.) 的棕榈蓟马 (*Thrips palmi*)、烟蓟马 (*Thripstabaci*);其它的温室蓟马 (*Heliothrips haemorrhoidalis*)、茶黄蓟马 (*Scirtothrips dorsalis*)。

[0225] (3) 半翅目 (Hemiptera) 的害虫

[0226] (A) 古喙亚目 (Archaeorrhyncha)

[0227] (a) 飞虱科 (Delphacidae) 的:例如,灰飞虱 (*Laodelphax striatella*)、褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*)、甘蔗扁角飞虱 (*Perkinsiella saccharicida*)、白背飞虱 (*Sogatella furcifera*)。

[0228] (B) 盾喙亚目 (Clypeorrhyncha)

[0229] (a) 叶蝉科 (Cicadellidae) 的:例如,小绿叶蝉属 (*Empoasca* spp.) 的马铃薯小绿叶蝉 (*Empoasca fabae*)、日本小绿叶蝉 (*Empoasca nipponica*)、小贯小绿叶蝉 (*Empoasca onukii*)、板井小绿叶蝉 (*Empoasca sakaii*);其它的葡萄斑叶蝉 (*Arboridia apicalis*)、黑胸二室叶蝉 (*Balclutha saltuella*)、二点大叶蝉 (*Epiacanthus stramineus*)、黑额二叉叶蝉 (*Macrosteles striifrons*)、黑尾叶蝉 (*Nephotettix cincticeps*)。

[0230] (C) 异翅亚目 (Heteroptera)

[0231] (a) 蛛缘蝽科 (Alydidae) 的:例如,点蜂缘椿象 (*Riptortus clavatus*);

- [0232] (b) 缘蝽科 (Coreidae) 的: 例如, 稻棘缘蝽 (*Cletus punctiger*)、中稻缘蝽 (*Leptocorisa chinensis*);
- [0233] (c) 长蝽科 (Lygaeidae) 的: 例如, 美洲谷长蝽 (*Blissus leucopterus*)、甘蔗异背长蝽 (*Cavelerius saccharivorus*)、葫芦长蝽 (*Togo hemipterus*);
- [0234] (d) 盲蝽科 (Miridae) 的: 例如, 日本跳盲蝽 (*Halticus insularis*)、美国牧草盲蝽 (*Lygus lineolaris*)、棉盲蝽 (*Psuedatomoscelis seriatus*)、西伯利亚狭盲蝽 (*Stenodema sibiricum*)、赤条纤盲蝽 (*Stenotus rubrovittatus*)、赤须盲蝽 (*Trigonotylus caelestialium*);
- [0235] (e) 蝽科 (Pentatomidae) 的: 例如, 绿蝽属 (*Nezara* spp.) 的黑须稻绿蝽 (*Nezara antennata*)、稻绿蝽 (*Nezara viridula*); 例如, 二星蝽属 (*Eysarcoris* spp.) 的北二星蝽 (*Eysarcoris aeneus*)、日本二星蝽 (*Eysarcoris lewisi*)、广二星蝽 (*Eysarcoris ventralis*); 其它的细毛蝽 (*Dolycoris baccarum*)、皱纹菜蝽 (*Eurydema rugosum*)、青蝽 (*Glaucias subpunctatus*)、茶翅蝽 (*Halyomorpha halys*)、璧蝽 (*Piezodorus hybneri*)、珀蝽 (*Plautia crossota*)、稻黑蝽 (*Scotinophora lurida*);
- [0236] (f) 红蝽科 (Pyrrhocoridae) 的: 例如, 离斑棉红蝽 (*Dysdercus cingulatus*);
- [0237] (g) 姬缘蝽科 (Rhopalidae) 的: 例如, 黄伊缘蝽 (*Rhopalus msculatus*);
- [0238] (h) 盾蝽科 (Scutelleridae) 的: 例如, 麦扁盾蝽 (*Eurygaster integriceps*);
- [0239] (i) 网蝽科 (Tingidae) 的: 例如, 梨冠网蝽 (*Stephanitis nashi*)。
- [0240] (D) 腹吻亚目 (Sternorrhyncha)
- [0241] (a) 球蚜科 (Adelgidae) 的: 例如, 落叶松球蚜 (*Adelges laricis*);
- [0242] (b) 粉虱科 (Aleyrodidae) 的: 例如, 小粉虱属 (*Bemisia* spp.) 的银叶粉虱 (*Bemisia argentifolii*)、烟粉虱 (*Bemisia tabaci*); 其它的黑刺粉虱 (*Aleurocanthus spiniferus*)、柑橘粉虱 (*Dialeurodes citri*)、温室白粉虱 (*Trialetrodes vaporariorum*);
- [0243] (c) 蚜科 (Aphididae) 的: 例如, 蚜属 (*Aphis* spp.) 的豆蚜 (*Aphis craccivora*)、黑豆蚜 (*Aphis fabae*)、草莓根蚜 (*Aphis forbesi*)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)、苹蚜 (*Aphis pomi*)、接骨木蚜 (*Aphis sambuci*)、绣线菊蚜 (*Aphis spiraeicola*); 例如, 缢管蚜属 (*Rhopalosiphum* spp.) 的玉米蚜 (*Rhopalosiphum maidis*)、禾谷缢管蚜 (*Rhopalosiphum padi*); 例如, 西圆尾蚜属 (*Dysaphis* spp.) 的玫瑰苹果蚜 (*Dysaphis plantaginea*)、居根西圆尾蚜 (*Dysaphis radicola*); 例如, 长管蚜属 (*Macrosiphum* spp.) 的麦长管蚜 (*Macrosiphum avenae*)、大戟长管蚜 (*Macrosiphum euphorbiae*); 例如, 瘤蚜属 (*Myzus* spp.) 的李瘤蚜 (*Myzus cerasi*)、桃蚜 (*Myzus persicae*)、黄药子瘤蚜 (*Myzus varians*); 其它的豌豆蚜 (*Acyrtosiphon pisum*)、茄沟无网蚜 (*Aulacorthum solani*)、金盏菊李短尾蚜 (*Brachycaudus helichrysi*)、甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*)、草莓钉蚜 (*Chaetosiphon fragaefolii*)、桃粉大尾蚜 (*Hyalopterus pruni*)、茶蔗苦菜超瘤蚜 (*Hyperomyzus lactucae*)、萝卜蚜 (*Lipaphis erysimi*)、巢菜修尾蚜 (*Megoura viciae*)、麦无网长管蚜 (*Metopolophium dirhodum*)、莴苣衲长管蚜 (*Nasonovia ribis-nigri*)、指头蚜 (*Phorodon humuli*)、麦二叉蚜 (*Schizaphis graminum*)、麦长管蚜 (*Sitobion avenae*)、橘二叉蚜 (*Toxoptera aurantii*);

- [0244] (d) 蜡蚧科 (Coccidae) 的:例如,蜡蚧属 (*Ceroplastes* spp.) 的角蜡蚧 (*Ceroplastes ceriferus*)、红蜡蚧 (*Ceroplastes rubens*);
- [0245] (e) 盾蚧科 (Diaspididae) 的:白盾蚧属 (*Pseudaulacaspis* spp.) 的桑白蚧 (*Pseudaulacaspis pentagona*)、李白盾蚧 (*Pseudaulacaspis prunicola*);例如,矢尖蚧属 (*Unaspis* spp.) 的卫矛矢尖蚧 (*Unaspis euonymi*)、柑桔矢尖蚧 (*Unaspis yanonensis*);其它的红圆蚧 (*Aonidiella aurantii*)、圣琼斯康盾蚧 (*Comstockaspis perniciosus*)、茶围盾蚧 (*Fiorinia theae*)、牡丹网盾蚧 (*Pseudoaonidia paeoniae*);
- [0246] (f) 硕蚧科 (Margarodidae) 的:例如,草履蚧 (*Drosicha corpulenta*)、吹绵蚧 (*Icerya purchasi*);
- [0247] (g) 根瘤蚜科 (Phylloxeridae) 的:例如,葡萄根瘤蚜 (*Viteus vitifolii*);
- [0248] (h) 粉蚧科 (Pseudococcidae) 的:例如,臀纹粉蚧属 (*Planococcus* spp.) 的柑桔粉蚧 (*Planococcus citri*)、日本臀纹粉蚧 (*Planococcus kuraunhiaie*);其它的石蒜绵粉蚧 (*Phenacoccus solani*)、康氏粉蚧 (*Pseudococcus comstocki*);
- [0249] (i) 木虱科 (Psyllidae) 的:例如,木虱属 (*Psylla* spp.) 的苹木虱 (*Psylla mali*)、梨木虱 (*Psylla pyrisuga*);其它的柑橘木虱 (*Diaphorina citri*)。
- [0250] (4) 多食亚目 (Polyphaga) 的害虫
- [0251] (a) 番死虫科 (Anobiidae) 的:例如,烟草甲 (*Lasioderma serricorne*);
- [0252] (b) 卷象科 (Attelabidae) 的:例如,梨卷叶象甲 (*Byctiscus betulae*)、日本苹虎 (*Rhynchites heros*);
- [0253] (c) 长蠹科 (Bostrichidae) 的:例如,褐粉蠹 (*Lyctus brunneus*);
- [0254] (d) 三锥象甲科 (Brentidae) 的:例如,甘薯蚁象 (*Cylas formicarius*);
- [0255] (e) 吉丁科 (Buprestidae) 的:例如,梨窄吉丁 (*Agrilus sinuatus*);
- [0256] (f) 天牛科 (Cerambycidae) 的:例如,白斑星天牛 (*Anoplophora malasiaca*)、松墨天牛 (*Monochamus alternatus*)、黄星天牛 (*Psacothea hilaris*)、葡萄脊虎天牛 (*Xylotrechus pyrrhoderus*);
- [0257] (g) 叶甲科 (Chrysomelidae) 的:例如,豆象属 (*Bruchus* spp.) 的豌豆象 (*Bruchus pisorum*)、蚕豆象 (*Bruchus rufimanus*);例如,叶甲属 (*Diabrotica* spp.) 的北方玉米根虫甲 (*Diabrotica barberi*)、十一星黄瓜甲虫 (*Diabrotica undecimpunctata*)、玉米根萤叶甲 (*Diabrotica virgifera*);例如,黄条跳甲属 (*Phyllotreta* spp.) 的大豆淡足跳甲 (*Phyllotreta nemorum*)、黄曲条跳甲 (*Phyllotreta striolata*);其它的黄守瓜 (*Aulacophora femoralis*)、绿豆象 (*Callosobruchus chinensis*)、甜菜大龟甲 (*Cassida nebulosa*)、甜菜跳甲 (*Chaetocnema concinna*)、马铃薯甲虫 (*Leptinotarsa decemlineata*)、水稻负泥虫 (*Oulema oryzae*)、狭胸蚤跳甲 (*Psylliodes angusticollis*);
- [0258] (h) 瓢虫科 (Coccinellidae) 的:例如,食植瓢虫属 (*Epilachna* spp.) 的墨西哥豆瓢虫 (*Epilachna varivestis*)、二十八星瓢虫 (*Epilachna vigintioctopunctata*);
- [0259] (i) 象甲科 (Curculionidae) 的:例如,花象属 (*Anthonomus* spp.) 的棉铃象甲虫 (*Anthonomus grandis*)、梨花象 (*Anthonomus pomorum*);例如,谷象属 (*Sitophilus* spp.) 的谷象 (*Sitophilus granarius*)、玉米象 (*Sitophilus zeamais*);其它的稻象甲 (*Echinocnemus squameus*)、西印度甘薯象甲 (*Euscepes postfasciatus*)、欧洲松树皮象

(*Hylobius abietis*)、苜蓿叶象(*Hypera postica*)、稻水象甲(*Lissohoptrus oryzophilus*)、葡萄黑象甲(*Otiorhynchus sulcatus*)、豌豆根瘤象(*Sitona lineatus*)、猎食谷象(*Sphenophorus venatus*)；

[0260] (j) 叩甲科(*Elateridae*)的：例如，梳爪叩甲属(*Melanotus* spp.)的褐纹金针虫(*Melanotus fortnumi*)、栉叩头虫(*Melanotus tamsuyensis*)；

[0261] (k) 露尾甲科(*Nitidulidae*)的：例如，姬扁出尾虫(*Epuraea domina*)；

[0262] (l) 金龟子科(*Scarabaeidae*)的：例如，异丽金龟属(*Anomala* spp.)的赤铜丽金龟(*Anomala cuprea*)、红铜丽金龟(*Anomala rufocuprea*)；其它的金花金龟(*Cetonia aurata*)、小青花金龟(*Gametis jucunda*)、豆黄鳃金龟(*Heptophylla picea*)、大栗鳃角金龟(*Melolontha melolontha*)、日本金龟子(*Popillia japonica*)；

[0263] (m) 小蠹科(*Scolytidae*)的：例如，云杉八齿小蠹(*Ips typographus*)；

[0264] (n) 隐翅虫科(*Staphylinidae*)的：例如，红胸隐翅虫(*Paederus fuscipes*)；

[0265] (o) 拟步甲科(*Tenebrionidae*)的：例如，黄粉虫(*Tenebrio molitor*)、赤拟谷盗(*Tribolium castaneum*)；

[0266] (p) 谷盗科(*Trogossitidae*)的：例如，大谷盗(*Tenebroides mauritanicus*)。

[0267] (5) 双翅目(*Diptera*)的害虫

[0268] (A) 短角亚目(*Brachycera*)

[0269] (a) 潜蝇科(*Agromyzidae*)的：例如，斑潜蝇属(*Liriomyza* spp.)的番茄斑潜蝇(*Liriomyza bryoniae*)、葱潜叶蝇(*Liriomyza chinensis*)、美洲斑潜蝇(*Liriomyza sativae*)、三叶斑潜蝇(*Liriomyza trifolii*)；其它的豌豆潜叶蝇(*Chromatomyia horticola*)、日本稻潜蝇(*Agromyza oryzae*)；

[0270] (b) 花蝇科(*Anthomyiidae*)的：例如，地种蝇属(*Delia* spp.)的种蝇(*Delia platura*)、甘蓝根蝇(*Delia radicum*)；其它的油菜肖藜泉蝇(*Pegomya cunicularia*)；

[0271] (c) 果蝇科(*Drosophilidae*)的：例如，果蝇属(*Drosophila* spp.)的黑腹果蝇(*Drosophila melanogaster*)、斑翅果蝇(*Drosophila suzukii*)；

[0272] (d) 水蝇科(*Ephydriidae*)的：例如，水稻潜叶蝇(*Hydrellia griseola*)；

[0273] (e) 茎蝇科(*Psilidae*)的：例如，胡萝卜茎蝇(*Psila rosae*)；

[0274] (f) 实蝇科(*Tephritidae*)的：例如，果实蝇属(*Bactrocera* spp.)的瓜实蝇(*Bactrocera cucurbitae*)、橘小实蝇(*Bactrocera dorsalis*)；例如，绕实蝇属(*Rhagoletis* spp.)的樱桃绕实蝇(*Rhagoletis cerasi*)、苹果绕实蝇(*Rhagoletis pomonella*)；其它的地中海果蝇(*Ceratitis capitata*)、橄榄果蝇(*Dacus oleae*)。

[0275] (B) 长角亚目(*Nematocera*)

[0276] (a) 瘿蚊科(*Cecidomyiidae*)的：例如，大豆荚瘿蚊(*Asphondylia yushimai*)、高粱瘿蚊(*Contarinia sorghicola*)、黑森瘿蚊(*Mayetiola destructor*)、麦红吸浆虫(*Sitodiplosis mosellana*)。

[0277] (6) 直翅目(*Orthoptera*)的害虫

[0278] (a) 蝗科(*Acrididae*)的：例如，沙漠蝗属(*Schistocerca* spp.)的南美沙漠蝗(*Schistocerca americana*)、沙漠蝗(*Schistocerca gregaria*)；其它的澳大利亚灾蝗(*Chortoicetes terminifera*)、摩洛哥戟纹蝗(*Doclostaurus maroccanus*)、东亚飞蝗

(*Locusta migratoria*)、褐飞蝗(*Locustana pardalina*)、红翅蝗(*Nomadacris septemfasciata*)、小翅稻蝗(*Oxya yezoensis*)；

[0279] (b) 蟋蟀科(*Gryllidae*)的：例如，家蟋蟀(*Acheta domestica*)、黄脸油葫芦(*Teleogryllus emma*)；

[0280] (c) 蝼蛄科(*Gryllotalpidae*)的：例如，东方蝼蛄(*Gryllotalpa orientalis*)；

[0281] (d) 螽斯科(*Tettigoniidae*)的：例如，温室灶马(*Tachycines asynamorus*)。

[0282] (7) 蜱螨亚纲类(*Acari*)

[0283] (A) 无气门目(*Astigmata*)的粉螨亚目类(*Acaridida*)

[0284] (a) 粉螨科(*Acaridae*)的螨：例如，根螨属(*Rhizoglyphus* spp.)的刺足根螨(*Rhizoglyphus echinopus*)、罗宾根螨(*Rhizoglyphus robini*)；例如，食酪螨属(*Tyrophagus* spp.)的瓜食酪螨(*Tyrophagus neiswanderi*)、尘食酪螨(*Tyrophagus perniciosus*)、腐食酪螨(*Tyrophagus putrescentiae*)、似食酪螨(*Tyrophagus similis*)；以及粗脚粉螨(*Acarus siro*)、椭圆食粉螨(*Aleuroglyphus ovatus*)、菌食嗜菌螨(*Mycetoglyphus fungivorus*)；

[0285] (B) 前气门目(*Prostigmata*)的辐螨亚目类(*Actinedida*)

[0286] (a) 叶螨科(*Tetranychidae*)的螨：例如，苔螨属(*Bryobia* spp.)的苜蓿苔螨(*Bryobia praetiosa*)、果苔螨(*Bryobia rubrioculus*)；例如，始叶螨属(*Eotetranychus* spp.)的六点始叶螨(*Eotetranychus asiaticus*)、北始叶螨(*Eotetranychus boreus*)、朴始叶螨(*Eotetranychus celtis*)、膝状始叶螨(*Eotetranychus geniculatus*)、柑橘始叶螨(*Eotetranychus kankitus*)、李始叶螨(*Eotetranychus pruni*)、栲始叶螨(*Eotetranychus shii*)、史氏始叶螨(*Eotetranychus smithi*)、桑始叶螨(*Eotetranychus suginamensis*)、弯钩始叶螨(*Eotetranychus uncatatus*)；例如，小爪螨属(*Oligonychus* spp.)的柳杉小爪螨(*Oligonychus hondoensis*)、冬青小爪螨(*Oligonychus ilicis*)、落叶松小爪螨(*Oligonychus karamatus*)、芒果小爪螨(*Oligonychus mangiferus*)、甘蔗小爪螨(*Oligonychus orthius*)、鳄梨小爪螨(*Oligonychus perseae*)、虾夷云杉叶螨(*Oligonychus pustulosus*)、真槌小爪螨(*Oligonychus shinkajii*)、针叶小爪螨(*Oligonychus ununguis*)；例如，全爪螨属(*Panonychus* spp.)的桔全爪螨(*Panonychus citri*)、桑全爪螨(*Panonychus mori*)、苹果全爪螨(*Panonychus ulmi*)；例如，叶螨属(*Tetranychus* spp.)的朱砂叶螨(*Tetranychus cinnabarinus*)、神泽氏叶螨(*Tetranychus kanzawai*)、卢氏叶螨(*Tetranychus ludeni*)、柞木叶螨(*Tetranychus quercivorus*)、豆叶螨(*Tetranychus phaselus*)、二斑叶螨(*Tetranychus urticae*)、山楂叶螨(*Tetranychus viennensis*)、伊凡氏叶螨(*Tetranychus evansi*)；例如，缺爪螨属(*Aponychus* spp.)的竹缺爪螨(*Aponychus corpuzae*)、梧桐缺爪螨(*Aponychus firmianae*)；例如，绿叶螨属(*Sasanychus* spp.)的绿叶螨(*Sasanychus akitanus*)、姬绿叶螨(*Sasanychus pusillus*)；例如，裂爪螨属(*Shizotetranychus* spp.)的嗜竹裂爪螨(*Shizotetranychus celarius*)、长肌裂爪螨(*Shizotetranychus longus*)、芒草裂爪螨(*Shizotetranychus miscanthi*)、勒氏裂爪螨(*Shizotetranychus recki*)、柳裂爪螨(*Shizotetranychus schizopus*)；另外，酢浆草如叶螨(*Tetranychina harti*)、孔雀杜克叶螨(*Tuckerella pavoniformis*)、札幌叶螨(*Yezonychus sapporensis*)；

[0287] (b) 细须螨科 (Tenuipalpidae) 的螨: 例如, 短须螨属 (*Brevipalpus* spp.) 的刘氏短须螨 (*Brevipalpus lewisi*)、卵形短须螨 (*Brevipalpus obovatus*)、紫红短须螨 (*Brevipalpus phoenicis*)、仙人掌短须螨 (*Brevipalpus russulus*)、加州短须螨 (*brevipalpus californicus*); 例如, 细须螨属 (*Tenuipalpus* spp.) 的太平洋细须螨 (*Tenuipalpus pacificus*)、柿细须螨 (*Tenuipalpus zhizhilashviliae*); 以及菠萝长叶螨 (*Dolichotetranychus floridanus*);

[0288] (c) 瘿螨科 (Eriophyidae) 的螨: 例如, 瘤瘿螨属 (*Aceria* spp.) 的柿子芽螨 (*Aceria diospyri*)、无花果瘤瘿螨 (*Aceria ficus*)、日本瘤瘿螨 (*Aceria japonica*)、枸杞瘤瘿螨 (*Aceria kuko*)、石竹瘤瘿螨 (*Aceria paradianthi*)、枸杞叶潜瘤瘿螨 (*Aceria tiyingi*)、郁金香瘤瘿螨 (*Aceria tulipae*)、结缕草瘤瘿螨 (*Aceria zoysiea*); 例如, 瘿螨属 (*Eriophyes* spp.) 的伪梨瘿螨 (*Eriophyes chibaensis*)、梅瘿螨 (*Eriophyes emarginatae*); 例如, 刺皮瘿螨属 (*Aculops* spp.) 的番茄刺皮瘿螨 (*Aculops lycopersici*)、皮氏刺皮瘿螨 (*Aculops pelekassi*); 例如, 刺瘿螨属 (*Aculus* spp.) 的佛氏刺瘿螨 (*Aculus fockeui*)、苹果刺锈螨 (*Aculus schlechtendali*); 以及茶尖叶节婢 (*Acaphylla theavagrans*)、茶叶瘿螨 (*Calacarus carinatus*)、葡萄缺节瘿螨 (*Colomerus vitis*)、葡萄叶锈螨 (*Calepitrimerus vitis*)、梨上瘿螨 (*Epitrimerus pyri*)、菊花叶锈螨 (*Paraphytoptus kikis*)、罗汉松副丽瘿螨 (*Paracalacarus podocarpi*)、柑橘锈螨 (*Phyllocotruta citri*);

[0289] (d) 跗线螨科 (Transonemidae) 的螨, 例如, 跗线螨属 (*Tarsonemus* spp.) 的双叶跗线螨 (*Tarsonemus bilobatus*)、韦氏跗线螨 (*Tarsonemus waitei*); 以及樱草植食螨 (*Phytonemus pallidus*)、侧多食跗线螨 (*Polyphagotarsonemus latus*);

[0290] (e) 叶爪螨科 (Penthaleidae) 的螨: 例如, 叶爪螨属 (*Penthaleus* spp.) 的白菜螨 (*Penthaleus erythrocephalus*)、麦叶爪螨 (*Penthaleus major*)。

[0291] 本发明的有害生物防除剂可以与杀菌剂、杀虫·杀螨剂、杀线虫剂、杀土壤害虫剂等其它有效成分; 植物调节剂、增效剂、肥料、土壤改良剂、动物用饲料等混用或并用。

[0292] 本发明的杂芳基嘧啶化合物与其它有效成分的组合可以对杀虫·杀螨·杀线虫活性期待协同效果。协同效果可以根据常规方法利用 Colby 公式 (Colby, S.R.; Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations; Weeds 15, 20-22 页, 1967) 来确认。

[0293] 以下示出可以与本发明的有害生物防除剂混用或并用的杀虫·杀螨剂、杀线虫剂、杀土壤害虫剂、驱虫剂等的具体例。

[0294] (1) 乙酰胆碱酯酶抑制剂:

[0295] (a) 氨基甲酸酯系: 棉铃威 (alanycarb)、涕灭威 (aldicarb)、噁虫威 (bendiocarb)、丙硫克百威 (benfuracarb)、丁叉威 (butocarboxim)、氧丁叉威 (butoxycarboxim)、甲萘威 (carbaryl)、克百威 (carbofuran)、丁硫克百威 (carbosulfan)、乙硫苯威 (ethiofencarb)、仲丁威 (fenobucarb)、伐虫脒 (formetanate)、呋线威 (furathiocarb)、异丙威 (isoprocarb)、甲硫威 (methiocarb)、灭多威 (methomyl)、杀线威 (oxamyl)、抗蚜威 (pirimicarb)、残杀威 (propoxur)、硫双威 (thiodicarb)、久效威 (thiofanox)、啉蚜威 (triazamate)、混杀威 (trimetacarb)、XMC、灭杀威 (xylylcarb); 苯硫

威 (fenothiocarb)、MIPC、MPMC、MTMC、砒灭威 (aldoxycarb)、除害威 (allyxycarb)、灭害威 (aminocarb)、合杀威 (bufencarb)、除线威 (cloethocarb)、威百亩钠 (metam-sodium)、猛杀威 (promecarb)；

[0296] (b) 有机磷系: 乙酰甲胺磷 (acephate)、甲基吡啶磷 (azamethiphos)、乙基谷硫磷 (azinphos-ethyl)、甲基谷硫磷 (azinphos-methyl)、硫线磷 (cadusafos)、氯氧磷 (chlorethoxyphos)、毒虫畏 (chlorfenvinphos)、氯甲磷 (chlormephos)、氯吡硫磷 (chlorpyrifos)、甲基氯吡硫磷 (chlorpyrifos-methyl)、蝇毒磷 (coumaphos)、杀螟腈 (cyanophos)、甲基内吸磷 (demeton-S-methyl)、二嗪磷 (diazinon)、敌敌畏 (dichlorvos)/DDVP、百治磷 (dicrotophos)、乐果 (dimethoate)、甲基毒虫畏 (dimethylvinphos)、乙拌磷 (disulfoton)、EPN、乙硫磷 (ethion)、丙线磷 (ethoprophos)、氨磺磷 (famphur)、苯线磷 (fenamphos)、杀螟硫磷 (fenitrothion)、倍硫磷 (fenthion)、噻唑硫磷 (fosthiazate)、庚烯磷 (heptenophos)、新烟磷 (imicyafos)、异柳磷 (isofenphos)、水胺硫磷 (isocarbophos)、异噁唑磷 (isoxathion)、马拉硫磷 (malathion)、灭蚜磷 (mecarbam)、甲胺磷 (methamidophos)、杀扑磷 (methidathion)、速灭磷 (mevinphos)、久效磷 (monocrotophos)、二溴磷 (naled)、氧化乐果 (omethoate)、砒吸磷 (oxydemeton-methyl)、对硫磷 (parathion)、甲基对硫磷 (parathion-methyl)、稻丰散 (phentoate)、甲拌磷 (phorate)、伏杀硫磷 (phosalone)、亚胺硫磷 (phosmet)、磷胺 (phosphamidon)、辛硫磷 (phoxim)、甲基嘧啶磷 (pirimiphos-methyl)、丙溴磷 (profenofos)、胺丙畏 (propetamphos)、丙硫磷 (prothiofos)、吡啶硫磷 (pyraclofos)、吡啶硫磷 (pyridaphenthion)、喹硫磷 (quinalphos)、治螟磷 (sulfotep)、丁基嘧啶磷 (tebupirimfos)、双硫磷 (temephos)、特丁硫磷 (terbufos)、杀虫威 (tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷 (thiometon)、三唑磷 (triazophos)、敌百虫 (trichlorfon)、蚜灭多 (vamidothion)、乙基溴硫磷 (bromophos-ethyl)、BRP、三硫磷 (carbophenothion)、苯腈磷 (cyanophenphos)、CYAP、甲基内吸磷砒 (demeton-S-methyl sulfone)、氯亚胺硫磷 (dialifos)、除线磷 (diclofenthion)、蔬果磷 (dioxabenzofos)、乙嘧硫磷 (etrimfos)、丰索磷 (fensulfothion)、吡氟硫磷 (flupyrazofos)、地虫硫磷 (fonofos)、安果 (formothion)、丁苯硫磷 (fosmethilan)、氯唑磷 (isazofos)、碘硫磷 (jodfenphos)、虫螨畏 (methacrifos)、乙基嘧啶磷 (pyrimiphos-ethyl)、磷虫威 (phosphocarb)、丙虫磷 (propaphos)、发果 (prothoate)、甲丙硫磷 (sulprofos)。

[0297] (2) GABA-激动性氯离子通道拮抗剂: 乙酰虫腈 (acetoprole)、氯丹 (chlordane)、硫丹 (endosulfan)、乙虫腈 (ethiprole)、氟虫腈 (fipronil)、吡啶氟虫腈 (pyrafluprole)、吡啶氟虫腈 (pyriprole)、毒杀芬 (camfechlor)、七氯 (heptachlor)、除螨灵 (dienochlor)。

[0298] (3) 钠通道调节剂: 氟丙菊酯 (acrinathrin)、d-顺式-反式丙烯菊酯 (d-cis-trans allethrin)、d-反式丙烯菊酯 (d-trans arethrin)、联苯菊酯 (bifenthrin)、生物丙烯菊酯 (bioallethrin)、生物丙烯菊酯s-环戊基异构体 (bioallethrin s-cyclopentyl isomer)、生物苜蓿菊酯 (bioresmethrin)、乙氧菊酯 (cycloprothrin)、氟氯氰菊酯 (cyfluthrin)、β-氟氯氰菊酯 (β-cyfluthrin)、氯氟氰菊酯 (cyhalothrin)、λ-氯氟氰菊酯 (λ-cyhalothrin)、γ-氯氟氰菊酯 (γ-cyhalothrin)、氯氰菊酯 (cypermethrin)、α-氯氰菊酯 (α-cypermethrin)、β-氯氰菊酯 (β-cypermethrin)、θ-氯氰菊酯 (θ-cypermethrin)、ζ-氯氰菊

酯(ζ -cypermethrin)、苯氰菊酯[(1R)-反式异构体](cyphenothrin[(1R)-trans isomer])、溴氰菊酯(deltamethrin)、烯炔菊酯[(EZ)-(1R)-异构体](Empenthrin[(EZ)-(1R)-Isomer])、顺式氰戊菊酯(esfenvalerate)、醚菊酯(etofenprox)、甲氰菊酯(fenpropathrin)、氰戊菊酯(fenvalerate)、氟氰戊菊酯(flucythrinate)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、 τ -氟胺氰菊酯(τ -fulvalinate)、苜蓿醚(halfenprox)、炔咪菊酯(imiprothrin)、噻恩菊酯(kadethrin)、氯菊酯(permethrin)、苯醚菊酯[(1R)-反式异构体](phenothrin[(1R)-trans isomer])、炔丙菊酯(prallethrin)、除虫菊(pyrethrum)、苜蓿菊酯(resmethrin)、氟硅菊酯(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin)、胺菊酯[(1R)-异构体](tetramethrin[(1R)-isomer])、四溴菊酯(tralomethrin)、四氟苯菊酯(transfluthrin)、丙烯菊酯(allethrin)、除虫菊酯(pyrethrins)、除虫菊酯I(pyrethrin I)、除虫菊酯II(pyrethrin II)、丙氟菊酯(profluthrin)、四氟甲醚菊酯(dimefluthrin)、生物苜蓿烯菊酯(bioethanomethrin)、生物氯菊酯(biopermethrin)、反式氯菊酯(transpermethrin)、芬氟司林(fenfluthrin)、氯氰吡菊酯(fenpirithrin)、溴氟菊酯(flubrocycythrinate)、三氟醚菊酯(flufenprox)、甲氧苄氟菊酯(metofluthrin)、丙苯炔菊酯(protrifenbute)、反灭虫菊(pyresmethrin)、环戊烯丙菊酯(terallethrin)。

[0299] (4) 烟碱型乙酰胆碱受体激动剂: 啉虫脒(acetamiprid)、噻虫胺(clothianidin)、呋虫胺(dinotefuran)、吡虫啉(imidacloprid)、烯啉虫胺(nitenpyram)、硝虫噻啉(nithiazine)、噻虫啉(thiacloprid)、噻虫嗪(thiamethoxam)、氟啉虫胺脒(sulfoxaflor)、尼古丁(nicotine)、氟吡呋喃酮(flupyradifurone)、N-[(E)-1-(6-氯-3-吡啶甲基)吡啶-2(1H)-亚基]-2,2,2-三氟乙酰胺(flupyrimine)。

[0300] (5) 烟碱型乙酰胆碱受体变构调节剂: 乙基多杀菌素(spinetoram)、多杀菌素(spinosad)。

[0301] (6) 氯离子通道激活剂: 阿维菌素(abamectin)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐(emamectin-benzoate)、雷皮菌素(lepimectin)、弥拜菌素(milbemectin)、伊维菌素(ivermectin)、塞拉菌素(selamectin)、多拉菌素(doramectin)、依普菌素(eprinomectin)、莫西菌素(moxidectin)、米尔倍霉素(milbemycin)、米尔贝肟(milbemycin oxime)、奈马菌素(nemadectin)。

[0302] (7) 保幼激素类似物: 烯虫乙酯(hydroprene)、烯虫炔酯(kinoprene)、甲氧普烯(methoprene)、苯氧威(fenoxycarb)、吡丙醚(pyriproxyfen)、苯虫醚(diofenolan)、保幼醚(epofenonane)、烯虫硫酯(triprene)。

[0303] (8) 其它非特异性抑制剂: 甲基溴(methyl bromide)、氯化苦(chloropicrin)、硫酰氟(sulfuryl fluoride)、硼砂(borax)、吐酒石(tartar emetic)。

[0304] (9) 同翅目选择性摄食抑制剂: 氟啉虫酰胺(flonicamid)、吡蚜酮(pymetrozine)、新啞啞啉(pyrifluquinazon)。

[0305] (10) 螨类繁殖抑制剂: 四螨嗪(clofentezine)、氟螨嗪(diflovidazin)、噻螨酮(hexythiazox)、乙螨唑(etoxazole)。

[0306] (11) 源自微生物的昆虫中肠内膜破坏剂: 苏云金芽孢杆菌以色列亚种(bacillus thuringiensis subsp. israelensis)、球形芽孢杆菌(bacillus sphaericus)、苏云金芽孢杆菌鮎泽亚种(bacillus thuringiensis subsp. aizawai)、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚

种(*Bacillus thuringiensis* subsp.*kurstaki*)、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种(*Bacillus thuringiensis* subsp.*tenebrionis*)、Bt作物蛋白质:Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/Cry35Ab1。

[0307] (12) 线粒体ATP生物合成酶抑制剂:丁醚脲(*diafenthiuron*)、三唑锡(*azocyclotin*)、三环锡(*cyhexatin*)、苯丁锡(*fenbutatin oxide*)、克螨特(*propargite*)、三氯杀螨砜(*tetradifon*)。

[0308] (13) 氧化磷酸化解偶联剂:溴虫腈(*chlorfenapyr*)、氟虫胺(*sulfuramid*)、DNOC、乐杀螨(*binapacryl*)、消螨通(*dinobuton*)、消螨普(*dinocap*)。

[0309] (14) 烟碱型乙酰胆碱受体通道阻断剂:杀虫磺(*bensultap*)、杀螟丹盐酸盐(*cartap hydrochloride*)、沙蚕毒素(*nereistoxin*)、杀虫双(*thiosultap-sodium*)、杀虫环(*thiocyclam*)。

[0310] (15) 几丁质合成抑制剂:双三氟虫脲(*bistrifluron*)、氟啶脲(*chlorfluazuron*)、除虫脲(*diflubenzuron*)、氟环脲(*flucyclozuron*)、氟虫脲(*flufenoxuron*)、氟铃脲(*hexaflumuron*)、虱螨脲(*lufenuron*)、双苯氟脲(*novaluron*)、多氟脲(*noviflumuron*)、伏虫隆(*teflubenzuron*)、杀铃脲(*triflumuron*)、噁螨酮(*buprofezin*)、吡虫隆(*fluazuron*)。

[0311] (16) 双翅目蜕皮干扰剂:灭蝇胺(*cyromazine*)。

[0312] (17) 蜕皮激素受体激动剂:环虫酰肼(*chromafenozide*)、氯虫酰肼(*halofenozide*)、甲氧虫酰肼(*methoxyfenozide*)、虫酰肼(*tebufenozide*)。

[0313] (18) 章鱼胺受体激动剂:双甲脒(*amitraz*)、得米地曲(*demiditraz*)、杀虫脒(*chlordimeform*)。

[0314] (19) 线粒体电子传递系统复合体III抑制剂:灭螨醌(*acequinocyl*)、噁螨酯(*fluacrypyrim*)、伏蚁脘(*hydramethylnon*)。

[0315] (20) 线粒体电子传递系统复合体I抑制剂:喹螨醚(*fenazaquin*)、唑螨酯(*fenpyroximate*)、噁螨醚(*pyrimidifen*)、吡啶灵(*pyridaben*)、吡螨胺(*tebufenpyrad*)、唑虫酰胺(*tolfenpyrad*)、鱼藤酮(*rotenone*)。

[0316] (21) 电压依赖性钠通道阻滞剂:茚虫威(*indoxacarb*)、氰氟虫腙(*metaflumizone*)。

[0317] (22) 乙酰基CoA羧化酶抑制剂:螺螨酯(*spirodiclofen*)、螺甲螨酯(*spiromesifen*)、螺虫乙酯(*spirotetramat*)。

[0318] (23) 线粒体电子传递系统复合体IV抑制剂:磷化铝(*aluminium phosphide*)、磷化钙(*calcium phosphide*)、磷(*phosphine*)、磷化锌(*zinc phosphide*)、氰化物(*cyanide*)。

[0319] (24) 线粒体电子传递系统复合体II抑制剂:腈吡螨酯(*cyenopyrafen*)、丁氟螨酯(*cyflumetofen*)、3'-异丁基-N-异丁酰基-1,3,5-三甲基-4'-[2,2,2-三氟-1-甲氧基-1-(三氟甲基)乙基]吡啶-4-甲酰苯胺(*pyflubumide*)。

[0320] (25) 兰尼碱受体调节剂:氯虫苯甲酰胺(*chlorantraniliprole*)、溴氰虫酰胺(*cyantraniliprole*)、氟虫双酰胺(*flubendiamide*)、环溴虫酰胺(*cyclaniliprole*)、氟氰虫酰胺(*tetraniliprole*)。

[0321] (26) 混合功能氧化酶抑制剂化合物:增效醚(*piperonyl butoxide*)。

[0322] (27) 蛛毒素受体激动剂:缩酚酸肽(*depsipeptide*)、环状缩酚酸肽

(cyclodepsipeptide)、24元环状缩酚酸肽(24membered cyclodepsipeptide)、艾莫德赛(emodeside)。

[0323] (28) 其它药剂(作用机理未知):印楝素(azadirachtin)、苯螨特(benzoximate)、联苯肼酯(bifenazate)、溴螨酯(bromopropylate)、灭螨猛(quinomethionate)、冰晶石(cryolite)、三氯杀螨醇(dicofol)、啉虫丙醚(pyridalyl)、异噻虫唑(benclothiaz)、硫(sulfur)、磺胺螨酯(amidoflumet)、1,3-二氯丙烯(1,3-dichloropropene)、DCIP、溴螨酯(phenisobromolate)、苯螨特(benzomate)、四聚乙醛(metaldehyde)、乙酯杀螨醇(chlorobenzilate)、氯噻苯(clothiazoben)、环虫腈(dicyclanil)、氧嘧酰胺(fenoxacrim)、芳氟胺(fentrifanil)、氟螨噻(flubenzimine)、氟奋乃静(fluphenazine)、红铃虫性诱素(gossyplure)、日本金龟子性诱素(japonilure)、噁虫酮(metoxadiazone)、石油(oil)、油酸钾(potassium oleate)、杀螨好(tetrasul)、苯螨噻(triarathene)、双丙环虫酯(afidopyropen)、氟麦托醌(flometoquin)、丁虫腈(flufiprole)、联氟砜(flusulfone)、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)、溴代吡咯腈(tralopyril)、四氟甲醚菊酯(dimethylfluthrin)、甲基新癸酰胺(methylneodecanamide)、氟雷拉纳(fluralaner)、阿福拉纳(afoxolaner)、氟噁唑酰胺(fluxametamide)、5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氢异噁唑-3-基]-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)苯甲腈(CAS:943137-49-3) (5-[5-(3,5-dichlorophenyl)-5-trifluoromethyl-4,5-dihydroisoxazole-3-yl]-2-(1H-1,2,4-triazole-1-yl) benzonitrile (CAS:943137-49-3))、溴虫氟苯双酰胺(broflanilide)、其它的间二酰胺类、小卷蛾斯氏线虫(steinernema carpocapsae)、格氏斯氏线虫(steinernema glaseri)、穿刺芽孢杆菌(pasteuria penetrans)、细脚拟青霉(paecilomyces tenuipes)、玫烟色拟青霉(paecilomyces fumosoroseus)、球孢白僵菌(beauveria bassiana)、布氏白僵菌(beauveria brongniartii)、金龟子绿僵菌(metarhizium anisopliae)、蜡蚧轮枝菌(verticillium lecanii)。

[0324] (29) 驱虫剂:

[0325] (a) 苯并咪唑系:芬苯达唑(fenbendazole)、阿苯达唑(albendazole)、三氯苯达唑(triclabendazole)、奥苯达唑(oxibendazole)、甲苯达唑(mebendazole)、奥芬达唑(oxfendazole)、帕苯达唑(parbendazole)、氟苯达唑(flubenzazole)、非班太尔(febantel)、奈韦拉平(netobimin)、托布津(thiophanate)、噻苯咪唑(thiabendazole)、堪苯达唑(cambendazole);

[0326] (b) 水杨酰苯胺系:氯氰碘柳胺(closantel)、五氯柳胺(oxyclozanide)、碘醚柳胺(rafoxanide)、氯硝柳胺(niclosamide);

[0327] (c) 取代酚系:硝碘酚腈(nitroxinil)、硝硫氰醚(nitroscanate);

[0328] (d) 嘧啶系:噻嘧啶(pyrantel)、甲噻吩嘧啶(morantel);

[0329] (e) 咪唑并噻唑系:左旋咪唑(levamisole)、四咪唑(tetramisole);

[0330] (f) 四氢嘧啶系:吡喹酮(praziquantel)、依西太尔(epsiprantel);

[0331] (g) 其它的驱虫药:环二烯(cyclodiene)、鱼尼丁(ryania)、氯舒隆(clorsulon)、甲硝唑(metronidazole)、得米地曲(demiditraz)、哌嗪(piperazine)、乙胺嗪(diethylcarbamazine)、二氯芬(dichlorophen)、莫奈太尔(monepantel)、三苯双胍

(tribendimidine)、阿米太尔(amidantel)、硫乙肿胺(thiacetarsamide)、美拉索明(melarsomine)、硫乙肿胺酸(arsenamide)。

[0332] 以下示出可以与本发明的有害生物防除剂混用或并用的杀菌剂的具体例。

[0333] (1) 核酸生物合成抑制剂:

[0334] (a) RNA聚合酶I抑制剂: 苯霜灵(benalaxyl)、精苯霜灵(benalaxyl-M)、呋霜灵(furalaxyl)、甲霜灵(metalaxyl)、精甲霜灵(metalaxyl-M)、霜灵(oxadixyl)、抑霉胺(clozylacon)、呋酰胺(ofurace);

[0335] (b) 腺苷脱氨酶抑制剂: 乙嘧啶磺酸酯(bupirimate)、甲菌定(dimethirimol)、乙嘧啶(ethirimol);

[0336] (c) DNA/RNA合成抑制剂: 噁霉灵(hymexazol)、辛噁酮(octhilinone);

[0337] (d) DNA拓扑异构酶II抑制剂: 噁喹酸(oxolinic acid)。

[0338] (2) 有丝核分裂抑制剂及细胞分裂抑制剂:

[0339] (a) β -微管蛋白聚合抑制剂: 苯菌灵(benomyl)、多菌灵(carbendazim)、苯咪唑菌(chlorfenazole)、麦穗宁(fuberidazole)、噁苯咪唑(thiabendazole)、托布津(thiophanate)、甲基硫菌灵(thiophanate-methyl)、乙霉威(diethofencarb)、苯酰菌胺(zoxamide)、噁唑菌胺(ethaboxam);

[0340] (b) 细胞分裂抑制剂: 戊菌隆(pencycuron);

[0341] (c) 类血影蛋白(spectrin-like protein)的离域抑制剂: 氟吡菌胺(fluopicolide)。

[0342] (3) 呼吸抑制剂:

[0343] (a) 复合体I NADH氧化还原酶抑制剂: 氟嘧菌胺(diflumetorim)、唑虫酰胺(tolfenpyrad);

[0344] (b) 复合体II琥珀酸脱氢酶抑制剂: 麦锈灵(benodanil)、氟酰胺(flutolanil)、灭锈胺(meprotil)、异丙噁菌胺(isofetamid)、氟吡菌酰胺(fluopyram)、甲呋酰胺(fenfuram)、拌种胺(furmecyclox)、萎锈灵(carboxin)、氧化萎锈灵(oxycarboxin)、噁呋酰胺(thifluzamide)、苯并烯氟菌唑(benzovindiflupyr)、联苯吡菌胺(bixafen)、氟唑菌酰胺(fluxapyroxad)、呋吡菌胺(furametpyr)、吡唑萘菌胺(isopyrazam)、戊苯吡菌胺(penflufen)、吡噁菌胺(penthiopyrad)、环苯吡菌胺(sedaxane)、啶酰菌胺(boscalid)、ピラジフルミド(pyraziflumid);

[0345] (c) 复合体III泛醌氧化酶Q_o抑制剂: 嘧菌脂(azoxystrobin)、丁香菌酯(coumoxystrobin)、甲香菌酯(coumethoxystrobin)、烯肟菌酯(enoxystrobin)、氟菌酰胺(flufenoxystrobin)、啶氧菌酯(picoxystrobin)、唑菌酯(pyraoxystrobin)、吡唑醚菌酯(pyraclostrobin)、唑胺菌酯(pyrametostrobin)、氯啶菌酯(triclopyricarb)、醚菌酯(kresoxim-methyl)、肟菌酯(trifloxystrobin)、醚菌胺(dimoxystrobin)、烯肟菌胺(fenaminstrobin)、苯氧菌胺(metominostrobin)、肟醚菌胺(orysastrobin)、噁唑菌酮(famoxadone)、氟嘧菌酯(fluxoxystrobin)、咪唑菌酮(fenamidone)、吡菌苯威(pyribencarb)、甲氧基丙烯酸酯类杀菌剂(mandestrobin);

[0346] (d) 复合体III泛醌还原酶Q_i抑制剂: 氰霜唑(cyazofamid)、吡唑磺菌胺(amisulbrom);

- [0347] (e) 氧化磷酸化的解偶联剂:乐杀螨(binapacryl)、敌螨普(meptyldinocap)、消螨普(dinocap)、氟啶胺(fluzinam)、噁菌腓(ferimzone);
- [0348] (f) 氧化磷酸化抑制剂(ATP合成酶的抑制剂):薯瘟锡(fentin acetate)、氯化三苯基锡(fentin chloride)、三苯基氢氧化锡(fentin hydroxide);
- [0349] (g) ATP生成抑制剂:硅噻菌胺(silthiofam);
- [0350] (h) 复合体III:细胞色素bc₁(泛醌还原酶)的Q_x(未知)抑制剂:唑噻菌胺(ametoctradin)。
- [0351] (4) 氨基酸及蛋白质合成抑制剂
- [0352] (a) 蛋氨酸生物合成抑制剂:安朵普灵(andoprim)、噁菌环胺(cyprodinil)、噁菌胺(mepanipyrim)、噁霉胺(pyrimethanil);
- [0353] (b) 蛋白质合成抑制剂:灭瘟素(blasticidin-S)、春雷霉素(kasugamycin)、春雷霉素盐酸盐(kasugamycin hydrochloride)、链霉素(streptomycin)、土霉素(oxytetracycline)。
- [0354] (5) 信号传导抑制剂:
- [0355] (a) 信号传导抑制剂:喹氧灵(quinoxifen)、丙氧喹啉(proquinazid);
- [0356] (b) 渗透压信号传导中的MAP·组氨酸激酶抑制剂:拌种咯(fenpiclonil)、咯菌腓(fludioxonil)、乙菌利(chlozolinate)、异菌脲(iprodione)、腐霉利(procymidone)、乙烯菌核利(vinclozolin)。
- [0357] (6) 脂质和细胞膜合成抑制剂:
- [0358] (a) 磷脂生物合成、甲基转移酶抑制剂:克瘟散(edifenphos)、异(a)磷脂生物合成、甲基转移酶抑制剂:克瘟散(edifenphos)、异稻瘟净(iprobenfos)、吡菌磷(pyrazophos)、稻瘟灵(isoprothiolane);
- [0359] (b) 脂质的过氧化剂:联苯(biphenyl)、地茂散(chloroneb)、氯硝胺(dichloran)、五氯硝基苯(quintozene)、四氯硝基苯(tecnazene)、甲基立枯磷(tolclofos-methyl)、土菌灵(etridiazole);
- [0360] (c) 作用于细胞膜的药剂:碘代丙炔基正丁氨基甲酸酯(iodocarb)、霜霉威(propamocarb)、霜霉威盐酸盐(propamocarb-hydrochloride)、霜霉威乙膦酸盐(propamocarb-fosetylalte)、硫菌威(prothiocarb);
- [0361] (d) 扰乱病原菌细胞膜的微生物:枯草芽孢杆菌(bacillus subtilis)、枯草芽孢杆菌QST713菌株(bacillus subtilis strain QST713)、枯草芽孢杆菌FZB24菌株(bacillus subtilis strain FZB24)、枯草芽孢杆菌MBI600菌株(bacillus subtilis strain MBI600)、枯草芽孢杆菌D747菌株(bacillus subtilis strain D747)、解淀粉芽孢杆菌(bacillus amyloliquefaciens);
- [0362] (e) 扰乱细胞膜的药剂:互生叶白千层(茶树)的提取物(melaleuca altemifolia (tea tree) extract)。
- [0363] (7) 细胞膜的甾醇生物合成抑制剂:
- [0364] (a) 甾醇生物合成中的C14位的脱甲基化抑制剂:噻氮灵(triforine)、啉斑脒(pyrifenox)、氯啉菌酯(pyrisoxazole)、氯苯嘧啶醇(fenarimol)、呋啉醇(flurprimidol)、氟苯嘧啶醇(nuarimol)、抑霉唑(imazalil)、抑霉唑硫酸盐(imazalil-

sulphate)、噁咪唑富马酸盐(oxpoconazole fumarate)、稻瘟酯(pefurazoate)、咪鲜胺(prochloraz)、氟菌唑(triflumizole)、烯效唑(viniconazole)、戊环唑(azaconazole)、双苯三唑醇(bitertanol)、糠菌唑(bromuconazole)、环唑醇(cyproconazole)、苜氯三唑醇(diclobutrazol)、苯醚甲环唑(difenoconazole)、烯唑醇(diniconazole)、烯唑醇-M(diniconazole-M)、氟环唑(epoxiconazole)、乙环唑(etaconazole)、腈苯唑(fenbuconazole)、氟喹唑(flusquinconazole)、氟硅唑(flusilazole)、粉唑醇(flutriafol)、氟康唑(furconazole)、顺式氟康唑(furconazole-cis)、己唑醇(hexaconazole)、亚胺唑(imibenconazole)、种菌唑(ipconazole)、叶菌唑(metconazole)、腈菌唑(myclobutanil)、戊菌唑(penconazole)、丙环唑(propiconazole)、氟喹唑(flusquinconazole)、硅氟唑(simeconazole)、戊唑醇(tebuconazole)、氟醚唑(tetraconazole)、三唑酮(triadimefon)、三唑醇(triadimenol)、灭菌唑(triticonazole)、丙硫菌唑(prothioconazole)、伏立康唑(voriconazole)、氯氟醚菌唑(mefentrifluconazole)；

[0365] (b) 甾醇生物合成中的 $\Delta 14$ 还原酶及 $\Delta 8 \rightarrow \Delta 7$ -异构酶的抑制剂：

[0366] 十二吗啉(aldimorph)、十二环吗啉(dodemorph)、十二环吗啉乙酸盐(dodemorph acetate)、丁苯吗啉(fenpropimorph)、十三吗啉(tridemorph)、苯锈啉(fenpropidin)、粉病灵(piperalin)、螺环菌胺(spiroxamine)；

[0367] (c) 甾醇生物合成体系的C4位脱甲基化中的3-酮还原酶抑制剂：

[0368] 环酰菌胺(fenhexamid)、胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)；

[0369] (d) 甾醇生物合成体系的角鲨烯环氧酶抑制剂：稗草丹(pyributicarb)、萘替芬(naftifine)、特比萘芬(terbinafine)。

[0370] (8) 细胞壁合成抑制

[0371] (a) 海藻糖酶抑制剂：井冈霉素(validamycin)；

[0372] (b) 几丁质合成酶抑制剂：多抗霉素(polyoxins)、多氧霉素(polyoxorim)；

[0373] (c) 纤维素合成酶抑制剂：烯酰吗啉(dimethomorph)、氟吗啉(flumorph)、丁吡吗啉(pyrimorph)、苯噻菌胺(benthiavalicarb-isopropyl)、丙森锌(iprovalicarb)、三氟甲氧威(tolprocarb)、霜霉灭(valifenalate)、双炔酰菌胺(mandipropamid)。

[0374] (9) 黑色素生物合成抑制剂

[0375] (a) 黑色素生物合成的还原酶抑制剂：四氯苯酐(ftalide)、咯喹酮(pyroquilon)、三环唑(tricyclazole)；

[0376] (b) 黑色素生物合成的脱水酶抑制剂：环丙酰菌胺(carpropamid)、双氯氰菌胺(diclocymet)、氰菌胺(fenoxanil)。

[0377] (10) 宿主植物的抗性诱导剂：

[0378] (a) 作用于水杨酸合成路线的药剂：阿拉酸式苯-S-甲基(acibenzolar-S-methyl)；

[0379] (b) 其它：烯丙苯噻唑(probenazole)、噻酰菌胺(tiadinil)、异噻菌胺(isotianil)、昆布多糖(laminarin)、大虎杖提取液(reynoutria sachalinensis extract)。

[0380] (11) 作用性不明的药剂：霜脲氰(cymoxanil)、三乙膦酸铝(fosetyl-aluminium)、

磷酸(磷酸盐)(phosphoric acid(phosphate))、叶枯酞(tecloftalam)、咪唑嗪(triazoxide)、磺菌胺(flusulfamide)、啞菌清(diclomezine)、磺菌威(methasulfocarb)、环氟菌胺(cyflufenamid)、苯菌酮(metrafenone)、甲氧苯啞菌(pyriofenone)、多果定(dodine)、多果定游离碱(dodine free base)、氟噻菌净(flutianil)。

[0381] (12) 具有多作用点的药剂:铜(铜盐)(copper(copper salt))、波尔多液(bordeaux mixture)、氢氧化铜(copper hydroxide)、萘二甲酸铜(copper naphthalate)、氧化铜(copper oxide)、氧氯化铜(copper oxychloride)、硫酸铜(copper sulfate)、硫(sulfur)、硫产品(sulfur product)、多硫化钙(calcium polysulfide)、福美铁(ferbam)、代森锰锌(mancozeb)、代森锰(maneb)、代森锰铜(mancopper)、代森联(metiram)、代森福美锌(polycarbamate)、丙森锌(propineb)、福美双(thiram)、代森锌(zineb)、福美锌(ziram)、克菌丹(captan)、敌菌丹(captafol)、灭菌丹(folpet)、百菌清(chlorothalonil)、苯氟磺胺(dichlofluanid)、对甲抑菌灵(tolyfluanid)、双胍盐(guazatine)、双胍辛胺乙酸盐(iminoctadine triacetate)、双胍三辛烷基苯磺酸盐(iminoctadine trialbesilate)、敌菌灵(anilazine)、二噻农(dithianon)、灭螨猛(quinomethionate)、啞味草(fluoroimide)。

[0382] (13) 其它药剂:DBEDC、氟灭菌丹(fluorofolpet)、双胍辛乙酸盐(guazatine acetate)、双(8-羟基喹啉)铜(II)(bis(8-quinolinolato)copper(II))、丙烷脒(propamidine)、氯化苦(chloropicrin)、酯菌胺(cyprofuram)、农杆菌(agrobacterium)、贝斯氧杂嗪(bethoxazin)、二苯胺(diphenylamine)、异硫氰酸甲酯(MITC)(methyl isothiocyanate)、米多霉素(mildiomycin)、辣椒素(capsaicin)、硫杂灵(cufraneb)、环丙磺酰胺(cyprosulfamide)、棉隆(dazomet)、咪菌威(debacarb)、双氯酚(dichlorophen)、氟联苯菌(flumetover)、乙磷钙(fosetyl-calcium)、乙磷钠(fosetyl-sodium)、人间霉素(irumamycin)、纳他霉素(natamycin)、酞菌酯(nitrothal isopropyl)、奥克斯莫卡宾(oxamocarb)、皮硝菌素(pyrrolnitrin)、异丁乙氧喹啉(tebufloquin)、甲磺菌胺(tolnifanide)、氰菌胺(zarilamide)、阿尔高费斯(algophase)、拌种灵(amicarthiazol)、氟噻唑吡乙酮(oxathiapiprolin)、代森联锌(metiram zinc)、苯噻硫氰(benthiazole)、水杨菌胺(trichlamide)、优康唑(uniconazole)、氧代奋欣(oxyfenthiin)、(6-[(Z)-(甲基-1H-5-四唑基)(苯基)亚甲基]氨基氧基甲基)-2-吡啶基)氨基甲酸特丁酯(picarbutrazox)、(3S,6S,7R,8R)-8-苄基-3-{3-[(异丁酰基氧)甲氧基]-4-甲氧基吡啶-2-甲酰胺基}-6-甲基-4,9-二氧代-1,5-二氧壬环-7-基异丁酸酯(fenpicoxamid)、3-(3,4-二氯-1,2-噻唑-5-基甲氧基)-1,2-苯并噻唑1,1-二氧化物(dichlobentiazox)、3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉(quinofumelin)、秋兰姆(thiuram)、代森铵(ambam)、放射形土壤杆菌(agrobacterium radiobacter)、盾壳霉(coniothyrium minitans)、荧光假单胞菌(pseudomonas fluorescens)、罗氏假单胞菌(pseudomonas rhodesiae)、黄蓝状菌(talaromyces flavus)、深绿木霉(trichoderma atroviride)、胡萝卜软腐欧文氏菌胡萝卜软腐亚种(erwinia carotovora subsp.carotovora)、简单芽胞杆菌(bacillus simplex)、争论贪噬菌(variovorax paradoxus)、植物乳杆菌(lactobacillus plantarum)。

[0383] 以下示出可以与本发明的有害生物防除剂混用或并用的植物调节剂的具体例。

[0384] 脱落酸(abscisic acid)、激动素(kinetin)、苄氨基嘌呤(Benzylaminopurine)、1,3-二苯基脲(1,3-diphenylurea)、氯吡脲(forchlorfenuron)、噻苯隆(thidiazuron)、吡效隆(chlorfenuron)、二氢玉米素(dihydrozeatin)、赤霉素A(gibberellin A)、赤霉素A4(gibberellin A4)、赤霉素A7(gibberellin A7)、赤霉素A3(gibberellin A3)、1-甲基环丙烷(1-methylcyclopropane)、N-乙酰基氨基乙氧基乙烯基甘氨酸(别名:四烯雌酮)(N-acetyl aminoethoxyvinyl glycine(aviglycine))、氨基氧乙酸(aminoxyacetate)、硝酸银(silver nitrate)、氯化钴(cobalt chloride)、3-吲哚乙酸(IAA)、4-CPA、调果酸(cloprop)、2,4-D、MCPB、吲哚-3-丁酸(indole-3-butyrate)、2,4-滴丙酸(dichlorprop)、酚硫杀(phenothiol)、1-萘乙酰胺(1-naphthyl acetamide)、吲唑酯(ethychlozate)、座果酸(cloxyfonac)、马来酰肼(maleic acid hydrazide)、2,3,5-三碘苯甲酸(2,3,5-triiodobenzoic acid)、水杨酸(salicylic acid)、水杨酸甲酯(methyl salicylate)、(-)-茉莉酸((-)-jasmonic acid)、茉莉酸甲酯(methyl jasmonate)、(+)-独脚金醇((+)-strigol)、(+)-脱氧独脚金醇((+)-deoxystrigol)、(+)-列当醇((+)-orobanchol)、(+)-高粱内酯((+)-sorgolactone)、4-氧代-4-(2-苯基乙基)氨基丁酸(4-oxo-4-(2-phenylethyl)aminobutyric acid)、乙烯利(ethephon)、矮壮素(chlormequat)、甲哌啉(mepiquat chloride)、苄基腺嘌呤(benzyladenine)、5-氨基乙酰丙酸(5-amino levulinic acid)、丁酰肼(daminozide)。

[0385] (体外寄生虫防除剂)

[0386] 本发明的体外寄生虫防除剂含有选自本发明的杂芳基嘧啶化合物中的至少一个作为有效成分。本发明的体外寄生虫防除剂中含有的杂芳基嘧啶化合物的量只要表现出体外寄生虫的防除效果就没有特别限制。

[0387] 作为本发明的体外寄生虫防除剂的处理对象的宿主动物,可以举出人、家畜哺乳动物(例如牛、马、猪、绵羊、山羊等)、实验动物(例如、小鼠、大鼠、沙鼠等)、宠物动物(例如仓鼠、豚鼠、狗、猫、马、松鼠、兔子、雪貂等)、野生和动物园的哺乳动物(猴子、狐狸、鹿、水牛等)、家禽(火鸡、鸭、鸡、鹌鹑、鹅等)、宠物鸟(鸽子、鹦鹉、鹩哥、文鸟、鸚哥、白腰文鸟、金丝雀等)等温血动物;或者鲑鱼、鳟鱼、锦鲤等鱼类。此外,还可以举出蜜蜂、锹形虫、独角仙。

[0388] 本发明的体外寄生虫防除剂可以通过公知的兽医学方法(局部、口服、非口服或皮下给药)进行施用。作为该方法,可举出通过片剂、胶囊、混入饲料等向动物口服给药的方法;通过浸渍液、栓剂、注射(肌内、皮下、静脉内、腹腔内等)等向动物给药的方法;通过喷雾、浇泼(pour on)、点涂(spot on)等将油性或水性液体制剂局部给药的方法;在树脂中混入体外寄生虫防除剂,将上述混炼物成型为项圈、耳标等合适的形状,将其佩戴在动物身上,从而局部给药的方法等。

[0389] 体外寄生虫寄生于宿主动物、特别是温血动物的体内和体表。详细而言,寄生在宿主动物的后背、腋下、下腹部、大腿的内侧部等而从动物获得血液或皮屑等营养源,从而得以生息。作为体外寄生虫,可举出螨类、虱类、蚤类、蚊子、角蝇、麻蝇等。以下示出可利用本发明的体外寄生虫防除剂来防除的体外寄生虫的具体例。

[0390] (1) 螨类(Acari)

[0391] 皮刺螨科(Dermanyssidae)的螨、巨刺螨科(Macronyssidae)的螨、厉螨科(Laelapidae)的螨、瓦螨科(Varroidae)的螨、软蜱科(Argasidae)的螨、硬蜱科(Ixodidae)

的螨、痒螨科 (Psoroptidae) 的螨、疥螨科 (Sarcoptidae) 的螨、膝螨科 (Knemidokoptidae) 的螨、蠕形螨科 (Demodixidae) 的螨、恙螨科 (Trombiculidae) 的螨、锹形虫类等昆虫寄生性螨。

[0392] (2) 虱目 (Phthiraptera)

[0393] 盲虱科 (Haematopinidae) 的虱、颚虱科 (Linognathidae) 的虱、短角鸟虱科 (Menoponidae) 的鸟虱、长角鸟虱科 (Philopterae) 的鸟虱、兽鸟虱科 (Trichodectidae) 的鸟虱。

[0394] (3) 将蚤目 (Siphonaptera)

[0395] 蚤科 (Pulicidae) 的蚤, 例如, 犬蚤属 (*Ctenocephalides* spp.) 的犬蚤 (*Ctenocephalides canis*)、猫蚤 (*Ctenocephalides felis*);

[0396] 潜蚤科 (Tungidae) 的蚤、角叶蚤科 (Ceratomyzidae) 的蚤、细蚤科 (Leptopsyllidae) 的蚤。

[0397] (4) 半翅目 (Hemiptera)。

[0398] (5) 双翅目 (Diptera) 的害虫

[0399] 蚊科 (Culicidae) 的蚊、蚋科 (Simuliidae) 的蚋、蠓科 (Ceratopogonidae) 的蠓、虻科 (Tabanidae) 的虻、蝇科 (Muscidae) 的蝇、舌蝇科 (Glossinidae) 的舌蝇、麻蝇科的麻蝇、虱蝇科 (Hippoboscidae) 的虱、丽蝇科 (Calliphoridae) 的蝇、狂蝇科 (Oestridae) 的蝇。

[0400] (体内寄生虫防除或驱除剂)

[0401] 本发明的体内寄生虫防除或驱除剂含有选自本发明的杂芳基嘧啶化合物中的至少一个作为有效成分。本发明的体内寄生虫防除或驱除剂中含有的杂芳基嘧啶化合物的量只要表现出体内寄生虫的防除效果就没有特别限制。

[0402] 作为本发明的体内寄生虫防除或驱除剂的对象寄生虫寄生于宿主动物、特别是温血动物或鱼类中(体内寄生虫)。作为本发明的体内寄生虫防除或驱除剂有效的宿主动物, 可以举出人、家畜哺乳动物(例如牛、马、猪、绵羊、山羊等)、实验动物(例如、小鼠、大鼠、沙鼠等)、宠物动物(例如仓鼠、豚鼠、狗、猫、马、松鼠、兔子、雪貂等)、野生和动物园的哺乳动物(猴子、狐狸、鹿、水牛等)、家禽(火鸡、鸭、鸡、鹌鹑、鹅等)、宠物鸟(鸽子、鹦鹉、鹩哥、文鸟、鸚哥、白腰文鸟、金丝雀等)等温血动物; 或者鲑鱼、鳟鱼、锦鲤等鱼类。通过防除和驱除寄生虫, 能够预防或治疗寄生虫介导的寄生虫疾病。

[0403] 作为防除或驱除对象的寄生虫, 可以举出以下的寄生虫。

[0404] (1) 膨结虫目 (Dioctophymatida) 的线虫类

[0405] (a) 膨结科 (Dioctophymatidae) 的肾膨结线虫: 例如, 膨结线虫属 (*Dioctophyma* spp.) 的肾膨结线虫 (*Dioctophyma renale*);

[0406] (b) 索氏膨结科 (Soboliphymatidae) 的肾膨结线虫: 例如, 芽结属 (*Soboliphyme* spp.) 的阿贝芽结线虫 (*Soboliphyme abei*)、巴氏芽结线虫 (*Soboliphyme baturini*)。

[0407] (2) 毛首目 (Trichocephalida) 的线虫类

[0408] (a) 毛线虫科 (Trichinellidae) 的旋毛虫: 例如, 毛线虫属 (*Trichinella* spp.) 的旋毛虫 (*Trichinella spiralis*);

[0409] (b) 鞭虫科 (Trichuridae) 的鞭虫: 例如, 毛细线虫属 (*Capillaria* spp.) 的环首毛细线虫 (*Capillaria annulata*)、捻转毛细线虫 (*Capillaria contorta*)、肝毛细线虫

(*Capillaria hepatica*)、穿孔毛细线虫(*Capillaria perforans*)、狐膀胱毛细线虫(*Capillaria plica*)、猪毛细线虫(*Capillaria suis*)；鞭虫属(*Trichuris* spp.)的犬鞭虫(*Trichuris vulpis*)、牛鞭虫(*Trichuris discolor*)、羊鞭虫(*Trichuris ovis*)、斯氏鞭虫(*Trichuris skrjabini*)、猪鞭虫(*Trichuris suis*)。

[0410] (3) 杆形线虫目(*Rhabditida*)的线虫类

[0411] 类圆线虫科(*Strongyloididae*)的类圆线虫：例如，类圆线虫属(*Strongyloides* spp.)的乳突类圆线虫(*Strongyloides papillosus*)、猫类圆线虫(*Strongyloides planiceps*)、猪兰氏类圆线虫(*Strongyloides ransomi*)、猪类圆线虫(*Strongyloides suis*)、粪类圆线虫(*Strongyloides stercoralis*)、美国猫类圆线虫(*Strongyloides tumefaciens*)、鼠类圆线虫(*Strongyloides ratti*)。

[0412] (4) 圆线虫目(*Strongylida*)的线虫类

[0413] 钩口科(*Ancylostomatidae*)的钩虫：例如，钩口属(*Ancylostoma* spp.)的巴西钩口线虫(*Ancylostoma braziliense*)、犬钩虫(*Ancylostoma caninum*)、十二指肠钩虫(*Ancylostoma duodenale*)、猫钩虫(*Ancylostoma tubaeforme*)；钩虫属(*Uncinaria stenocephala*)的狭首钩刺线虫(*Uncinaria stenocephala*)；仰口线虫属(*Bunostomum* spp.)的牛仰口线虫(*Bunostomum phlebotomum*)、羊仰口线虫(*Bunostomum trigonocephalum*)。

[0414] (5) 圆线虫目(*Strongylida*)的线虫类

[0415] (a) 管圆线虫科(*Angiostrongylidae*)的线虫：例如，猫圆线虫属(*Aelurostrongylus* spp.)的猫圆线虫(*Aelurostrongylus abstrusus*)；血管圆线虫属(*Angiostrongylus* spp.)的脉居管圆线虫(*Angiostrongylus vasorum*)、广州管圆线虫(*Angiostrongylus cantonesis*)；

[0416] (b) 锯体科(*Crenosomatidae*)的线虫：例如，环体线虫属(*Crenosoma* spp.)的肺毛细线虫(*Crenosoma aerophila*)、狐环体线虫(*Crenosoma vulpis*)；

[0417] (c) 类丝虫科(*Filaroididae*)的线虫：例如，类丝虫属(*Filaroides* spp.)的犬肺虫(*Filaroides hirathi*)、奥氏似丝线虫(*Filaroides osleri*)；

[0418] (d) 后圆线虫科(*Metastrongylidae*)的肺蠕虫：例如，后圆线虫属(*Metastrongylus* spp.)的猪圆线虫(*Metastrongylus apri*)、不对称后圆线虫(*Metastrongylus asymmetricus*)、复阴后圆形线虫(*Metastrongylus pudendotectus*)、萨氏后圆线虫(*Metastrongylus salmi*)；

[0419] (e) 比翼科(*Syngamidae*)的开嘴虫：例如，杯口线虫属(*Cyathostoma* spp.)的呵欠虫(*Cyathostoma bronchialis*)；比翼线虫属(*Syngamus* spp.)的斯氏比翼线虫(*Syngamus skrjabinomorpha*)、气管比翼线虫(*Syngamus trachea*)。

[0420] (6) 圆形目(*Strongylida*)的线虫类

[0421] (a) 莫林线虫科(*Molineidae*)的线虫：例如，细颈线虫属(*Nematodirus* spp.)的尖刺细颈线虫(*Nematodirus filicollis*)、钝刺细颈线虫(*Nematodirus spathiger*)；

[0422] (b) 网尾科(*Dictyocaulidae*)的线虫：例如，网尾属(*Dictyocaulus* spp.)的丝圆线虫(*Dictyocaulus filaria*)、胎生网尾线虫(*Dictyocaulus viviparus*)；

[0423] (c) 捻转胃虫科(*Haemonchidae*)的线虫：例如，血矛线虫属(*Haemonchus* spp.)的

捻转血矛线虫 (*Haemonchus contortus*); 长刺属 (*Mecistocirrus* spp.) 的指形长刺线虫 (*Mecistocirrus digitatus*);

[0424] (d) 捻转胃虫科 (*Haemonchidae*) 的线虫: 例如, 奥斯脱线虫属 (*Ostertagia* spp.) 的奥斯特线虫 (*Ostertagia ostertagi*);

[0425] (e) 单绕线虫科 (*Heligmonellidae*) 的线虫: 例如, 钩虫属 (*Nippostrongylus* spp.) 的巴西日圆线虫 (*Nippostrongylus braziliensis*);

[0426] (f) 毛圆线虫科 (*Trichostrongylidae*) 的线虫: 例如, 毛圆线虫属 (*Trichostrongylus* spp.) 的艾氏毛圆线虫 (*Trichostrongylus axei*)、蛇形毛圆线虫 (*Trichostrongylus colubriformis*)、微细毛圆线虫 (*Trichostrongylus tenuis*); 猪圆属 (*Hyostrongylus* spp.) 的红色猪圆线虫 (*Hyostrongylus rubidus*); 剑形属 (*Obeliscoides* spp.) 的兔尖柱线虫 (*Obeliscoides cuniculi*)。

[0427] (7) 圆形目 (*Strongylida*) 的线虫类

[0428] (a) 夏伯特科 (*Chabertiidae*) 的线虫: 例如, 夏伯特属 (*Chabertia* spp.) 的绵羊夏伯特线虫 (*Chabertia ovina*); 结节线虫属 (*Oesophagostomum* spp.) 的短尾结节线虫 (*Oesophagostomum brevicaudatum*)、哥伦比亚结节线虫 (*Oesophagostomum columbianum*)、有齿结节线虫 (*Oesophagostomum dentatum*)、佐治亚食管口线虫 (*Oesophagostomum georgianum*)、梅普尔斯通结节线虫 (*Oesophagostomum maplestonei*)、四棘食道口线虫 (*Oesophagostomum quadrispinulatum*)、辐射食道口线虫 (*Oesophagostomum radiatum*)、微管结节线虫 (*Oesophagostomum venulosum*)、华氏食道口线虫 (*Oesophagostomum watanabei*);

[0429] (b) 肾线科 (*Stephanuridae*) 的线虫: 例如, 冠线虫属 (*Stephanurus* spp.) 的有齿冠尾线虫 (*Stephanurus dentatus*);

[0430] (c) 圆线虫科 (*Strongylidae*) 的线虫: 例如, 圆线虫属 (*Strongylus* spp.) 的驴圆形线虫 (*Strongylus asini*)、无齿圆形线虫 (*Strongylus edentatus*)、马圆线虫 (*Strongylus equinus*)、寻常圆线虫 (*Strongylus vulgaris*)。

[0431] (8) 尖尾目 (*Oxyurida*) 的线虫类

[0432] 尖尾科 (*Oxyuridae*) 的线虫: 例如, 蛲虫属 (*Enterobius* spp.) 的黑猩猩蛲虫 (*Enterobius anthropopithecii*)、蛲虫 (*Enterobius vermicularis*); 尖尾线虫属 (*Oxyuris* spp.) 的马尖尾线虫 (*Oxyuris equi*); 栓尾属 (*Passalurus* spp.) 的兔栓尾线虫 (*Passalurus ambiguus*)。

[0433] (9) 蛔虫目 (*Ascaridida*) 的线虫类

[0434] (a) 禽蛔科 (*Ascaridiidae*) 的线虫: 例如, 鸡蛔虫属 (*Ascaridia* spp.) 的鸡蛔虫 (*Ascaridia galli*);

[0435] (b) 异刺科 (*Heterakidae*) 的线虫: 例如, 异刺属 (*Heterakis* spp.) 的贝兰渡异刺线虫 (*Heterakis beramporia*)、短刺异刺线虫 (*Heterakis brevispiculum*)、鸡异刺线虫 (*Heterakis gallinarum*)、小鸡异刺线虫 (*Heterakis pusilla*)、南方异刺线虫 (*Heterakis putaustralis*);

[0436] (c) 异尖科 (*Anisakidae*) 的线虫: 例如, 异尖线虫属 (*Anisakis* spp.) 的简单异尖线虫 (*Anisakis simplex*);

[0437] (d) 蛔虫科 (Ascarididae) 的线虫:例如,蛔虫属 (*Ascaris* spp.) 的似蚓蛔线虫 (*Ascaris lumbricoides*)、猪蛔虫 (*Ascaris suum*);副蛔虫属 (*Parascaris* spp.) 的马蛔虫 (*Parascaris equorum*);

[0438] (e) 弓首科 (Toxocaridae) 的线虫:例如,弓首属 (*Toxocara* spp.) 的犬蛔虫 (*Toxocara canis*)、犬小蛔虫 (*Toxocara leonina*)、猪蛔虫 (*Toxocarassuum*)、牛蛔虫 (*Toxocara vitulorum*)、猫蛔虫 (*Toxocara cati*)。

[0439] (10) 旋尾目 (Spirurida) 的线虫类

[0440] (a) 蟠尾丝虫科 (Onchocercidae) 的线虫:例如,布鲁线虫属 (*Brugia* spp.) 的马来布鲁线虫 (*Brugia malayi*)、彭亨布鲁线虫 (*Brugia pahangi*)、派特布鲁丝虫 (*Brugia patei*);棘唇线虫属 (*Dipetalonema* spp.) 的隐蔽棘唇线虫 (*Dipetalonema reconditum*);恶丝虫属 (*Dirofilaria* spp.) 的犬恶丝虫 (*Dirofilaria immitis*);丝虫属 (*Filaria* spp.) 的罗阿丝虫 (*Filaria oculi*);盘尾属 (*Onchocerca* spp.) 的马颈盘尾丝虫 (*Onchocerca cervicalis*)、吉氏盘尾丝虫 (*Onchocerca gibsoni*)、喉瘤盘尾丝虫 (*Onchocerca gutturosa*);

[0441] (b) 丝状科 (Setariidae) 的线虫:例如,丝虫属 (*Setaria* spp.) 的指状丝状虫 (*Setaria digitata*)、马腹腔丝虫 (*Setaria equina*)、牛腹腔唇乳突丝虫 (*Setaria labiatopapillosa*)、马氏丝虫 (*Setaria marshalli*);吴策线虫属 (*Wuchereria* spp.) 的班氏线虫 (*Wuchereria bancrofti*);

[0442] (c) 丝虫科 (Filariidae) 的线虫:例如,副丝虫属 (*Parafilaria* spp.) 的多乳突副丝虫 (*Parafilaria multipapillosa*);冠丝虫属 (*Stephanofilaria* spp.) 的阿萨麦冠丝虫 (*Stephanofilaria assamensis*)、德氏冠丝虫 (*Stephanofilaria dedoesi*)、咖氏冠丝虫 (*Stephanofilaria kaeli*)、冲绳丝虫 (*Stephanofilaria okinawaensis*)、斯氏冠丝虫 (*Stephanofilaria stilesi*)。

[0443] (11) 旋尾目 (Spirurida) 的线虫类

[0444] (a) 颚口科 (Gnathostomatidae) 的线虫:例如,颚口线虫属 (*Gnathostoma* spp.) 的多氏棘颚口线虫 (*Gnathostoma doloresi*)、陶氏颚口线虫 (*Gnathostoma spinigerum*);

[0445] (b) 柔线科 (Habronematidae) 的线虫:例如,丽线虫属 (*Habronema* spp.) 的大柔线虫 (*Habronema majus*)、小口柔线虫 (*Habronema microstoma*)、蝇柔线虫 (*Habronema muscae*);拉斯属 (*Draschia* spp.) 的大口德拉希线虫 (*Draschia megastoma*);

[0446] (c) 泡翼科 (Physalopteridae) 的线虫:例如,泡翼线虫属 (*Physaloptera* spp.) 的犬泡翼线虫 (*Physaloptera canis*)、狐狸胃虫 (*Physaloptera cesticillata*)、泡翼线虫 (*Physaloptera erdocyona*)、猫胃虫 (*Physaloptera felidis*)、埃及猫胃虫 (*Physaloptera gemina*)、*Physaloptera papilloradiata*、包皮泡翼线虫 (*Physaloptera praeputialis*)、*Physaloptera pseudopraeputialis*、稀泡翼线虫 (*Physaloptera rara*)、西伯利亚泡翼线虫 (*Physaloptera sibirica*)、*Physaloptera vulpineus*;

[0447] (d) 筒线科 (Gongylonematidae) 的线虫:例如,筒线属 (*Gongylonema* spp.) 的美丽筒线虫 (*Gongylonema pulchrum*);

[0448] (e) 尾旋科 (Spirocercidae) 的线虫:例如,斜环咽线虫属 (*Ascarops* spp.) 的圆形蛔状线虫 (*Ascarops strongylina*);

[0449] (f) 吸吮科 (Thelaziidae) 的线虫: 例如, 吸吮属 (Thelazia spp.) 的丽嫩吸吮线 (Thelazia callipaeda)、露德西吸吮线虫 (Thelazia gulosa)、泪管吸吮线虫 (Thelazia lacrymalis)、罗氏吸吮线虫 (Thelazia rhodesi)、斯氏吸吮线虫 (Thelazia skrjabini)。

[0450] (其它有害生物的防除剂)

[0451] 另外, 本发明的杂芳基嘧啶化合物除此之外, 还对具有毒针或毒液、对人畜有害的害虫、传播各种病原体、病原菌的害虫、给人带来不快感的害虫 (有毒害虫、卫生害虫、令人不快的害虫等) 具有优异的防除效果。

[0452] 以下示出其具体例。

[0453] (1) 膜翅目 (Hymenoptera) 的害虫

[0454] 三节叶蜂科 (Argidae) 的蜂、瘿蜂科 (Cynipidae) 的蜂、松叶蜂科 (Diprionidae) 的蜂、蚁科 (Formicidae) 的蚂蚁、蚁蜂科 (Mutillidae) 的蜂、胡蜂科 (Vespidae) 的蜂。

[0455] (2) 其它害虫

[0456] 蟑螂类 (Blattodea)、白蚁类 (termite)、蜘蛛类 (Araneae)、蜈蚣类 (centipede)、马陆类 (millipede)、甲壳类 (crustacea)、温带臭虫 (Cimex lectularius)。

[0457] [实施例]

[0458] (制剂处方)

[0459] 虽然示出了若干本发明的有害生物防除剂、杀虫或杀螨剂、体外寄生虫防除剂或体内寄生虫防除或驱除剂的制剂处方, 但添加物和添加比例不应限定于这些实施例, 可以在大范围内变化。制剂处方中的份表示重量份。

[0460] 以下示出农业园艺用和水稻用的制剂处方。

[0461] (制剂1: 可湿性粉剂)

[0462] 将本发明的杂芳基嘧啶化合物40份、硅藻土53份、高级醇硫酸酯4份和烷基萘磺酸盐3份均匀地混合并微细地粉碎, 得到有效成分40%的可湿性粉剂。

[0463] (制剂2: 乳剂)

[0464] 将本发明的杂芳基嘧啶化合物30份、二甲苯33份、二甲基甲酰胺30份和聚氧乙烯烷基烯丙基醚7份混合溶解, 得到有效成分30%的乳剂。

[0465] (制剂3: 粒剂)

[0466] 将本发明的杂芳基嘧啶化合物5份、滑石40份、粘土38份、膨润土10份和烷基硫酸钠7份均匀地混合并微细地粉碎后, 造粒成直径0.5~1.0mm的粒状, 得到有效成分5%的粒剂。

[0467] (制剂4: 粒剂)

[0468] 将本发明的杂芳基嘧啶化合物5份、粘土73份、膨润土20份、磺基琥珀酸二辛酯钠盐1份和磷酸钾1份充分粉碎混合, 加入水充分混炼后, 进行造粒干燥, 得到有效成分5%的粒剂。

[0469] (制剂5: 悬浮剂)

[0470] 将本发明的杂芳基嘧啶化合物10份、聚氧乙烯烷基烯丙基醚4份、聚羧酸钠盐2份、甘油10份、黄原胶0.2份和水73.8份混合, 湿式粉碎至粒度为3微米以下, 得到有效成分10%的悬浮剂。

[0471] 以下示出体外寄生虫防除剂、或者体内寄生虫防除或驱除剂的制剂处方。

[0472] (制剂6:颗粒剂)

[0473] 使本发明的杂芳基嘧啶化合物5份溶解于有机溶剂中而得到溶液,将上述溶液喷雾到高岭土94份和白炭黑1份上,接着在减压下蒸发溶剂。这种颗粒可以与动物的饲料混合。

[0474] (制剂7:注入剂)

[0475] 将本发明的杂芳基嘧啶化合物0.1~1份和花生油99~99.9份均匀地混合,接着,利用灭菌过滤器进行过滤灭菌。

[0476] (制剂8:浇泼剂)

[0477] 将本发明的杂芳基嘧啶化合物5份、肉豆蔻酸酯10份和异丙醇85份均匀地混合而得到浇泼剂。

[0478] (制剂9:点涂剂)

[0479] 将本发明的杂芳基嘧啶化合物10~15份、棕榈酸酯10份和异丙醇75~80份均匀地混合而得到点涂剂。

[0480] (制剂10:喷涂剂)

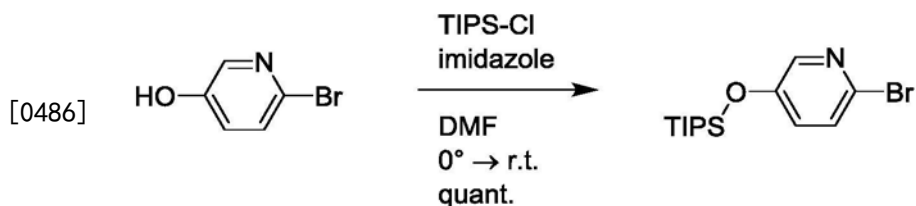
[0481] 将本发明的杂芳基嘧啶化合物1份、丙二醇10份和异丙醇89份均匀地混合而得到喷涂剂。

[0482] 接下来,示出化合物实施例,对本发明进行更具体的说明。但是,本发明不受以下的化合物实施例任何限制。

[0483] (实施例1)

[0484] 5-(乙基磺酰基)-4-(5-(2,2,2-三氟乙氧基)吡啶-2-基)-2,2'-联嘧啶(5-(ethylsulfonyl)-4-(5-(2,2,2-trifluoroethoxy)pyridin-2-yl)-2,2'-bipyrimidine)(化合物编号1-2)的合成

[0485] (工序1) 2-溴-5-((三异丙基甲硅烷基)氧基)吡啶(2-bromo-5-((triisopropylsilyl)oxy)pyridine)的合成

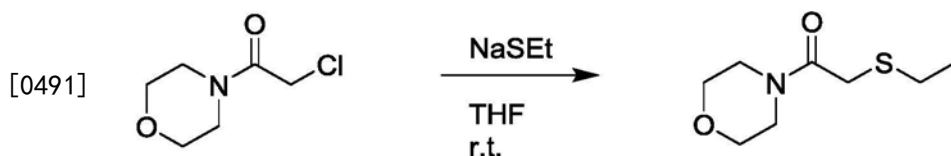


[0487] 使6-溴吡啶-3-醇(23g)和咪唑(11g)溶解于N,N-二甲基甲酰胺(130ml),在0°C搅拌。向其中加入三异丙基氯硅烷(34ml,0.90g/ml),在室温下搅拌过夜。将得到的液体倒入饱和碳酸氢钠溶液中,用乙酸乙酯萃取。将得到的有机层用饱和食盐水清洗,用无水硫酸镁干燥,进行过滤。将滤液减压浓缩,利用硅胶柱色谱对得到的残渣进行纯化,由此得到目标物45g(收率quant.)。

[0488] 以下示出所得的目标物的¹H-NMR。

[0489] ¹H-NMR(400MHz,CDC1₃):δ8.02(d,1H),7.32(d,1H),7.07(dd,1H),1.29-1.20(m,3H),1.10(d,18H)。

[0490] (工序2) 2-(乙硫基)-1-吗啉基乙烷-1-酮(2-(ethylthio)-1-morpholinoethan-1-one)的合成

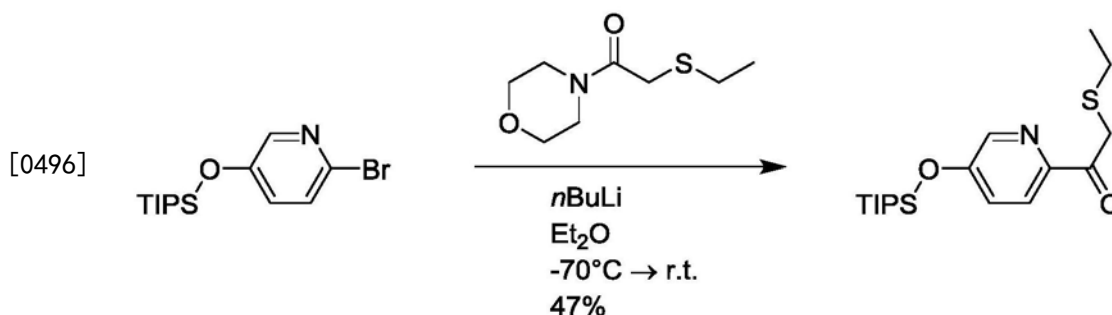


[0492] 使4-(氯乙酰基)吗啉(1g)溶解于四氢呋喃(30ml),在0℃搅拌。向其中加入乙硫醇钠(0.64g,80%),在室温下搅拌过夜。将得到的液体用乙醚稀释,进行硅藻土过滤。将滤液减压浓缩,得到的残渣(1.3g)无需纯化即用于下一工序。

[0493] 以下示出所得的目标物的¹H-NMR。

[0494] ¹H-NMR(400MHz,CDCl₃):δ3.74-3.50(m,8H),3.32(s,2H),2.67(q,2H),1.30(t,3H)。

[0495] (工序3)2-(乙硫基)-1-(5-((三异丙基甲硅烷基)氧基)吡啶-2-基)乙烷-1-酮(2-(ethylthio)-1-(5-((triisopropylsilyl)oxy)pyridin-2-yl)ethan-1-one)的合成

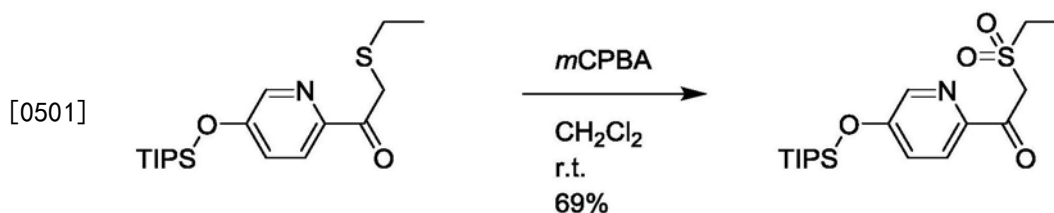


[0497] 使2-溴-5-((三异丙基甲硅烷基)氧基)吡啶(1.8g)溶解于四氢呋喃(30ml),将反应容器内用氮置换后,冷却到-70℃。向其中滴加正丁基锂(2.65M,正己烷溶液,2.5ml),以-70℃搅拌一小时。向其中加入工序2中得到的2-(乙硫基)-1-吗啉基乙烷-1-酮(1.2g),在室温下搅拌2小时。将得到的液体倒入水中,用乙酸乙酯进行萃取。将得到的有机层用饱和食盐水清洗,用无水硫酸镁干燥,进行过滤。将滤液减压浓缩,利用硅胶柱色谱对得到的残渣进行纯化,由此得到目标物0.90g(收率47%)。

[0498] 以下示出所得的目标物的¹H-NMR。

[0499] ¹H-NMR(400MHz,CDCl₃):δ8.26(d,1H),8.03(d,1H),7.25(dd,1H),4.03(s,2H),2.62(q,2H),1.36-1.22(m,6H),1.11(d,18H)。

[0500] (工序4)2-(乙基磺酰基)-1-(5-((三异丙基甲硅烷基)氧基)吡啶-2-基)乙烷-1-酮(2-(ethylsulfonyl)-1-(5-((triisopropylsilyl)oxy)pyridin-2-yl)ethan-1-one)的合成



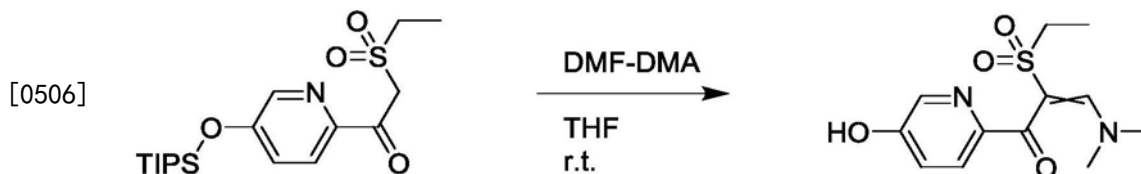
[0502] 使2-(乙硫基)-1-(5-((三异丙基甲硅烷基)氧基)吡啶-2-基)乙烷-1-酮(9.2g)溶解于二氯甲烷(260ml),在0℃搅拌。向其中加入间氯过氧苯甲酸(70%,14g),在室温下搅拌1小时。将得到的液体倒入饱和碳酸氢钠水溶液和饱和硫代硫酸钠水溶液的混合

溶液中,用二氯甲烷进行萃取。将得到的有机层用饱和食盐水清洗,用无水硫酸镁干燥,进行过滤。将滤液减压浓缩,利用硅胶柱色谱对得到的残渣进行纯化,由此得到目标物6.9g (收率69%)。

[0503] 以下示出所得的目标物的¹H-NMR。

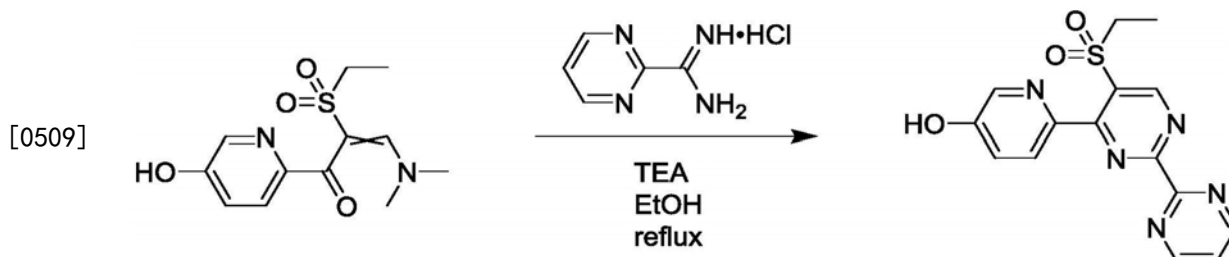
[0504] ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃): δ8.30 (d, 1H), 8.01 (d, 1H), 7.27 (dd, 1H), 4.95 (s, 2H), 3.31 (q, 2H), 1.46 (t, 3H), 1.36-1.24 (m, 3H), 1.12 (d, 18H)。

[0505] (工序5) 3-(二甲基氨基)-2-(乙基磺酰基)-1-(5-羟基吡啶-2-基)-2-丙烯-1-酮(3-(dimethylamino)-2-(ethylsulfonyl)-1-(5-hydroxypyridin-2-yl) prop-2-en-1-one)的合成



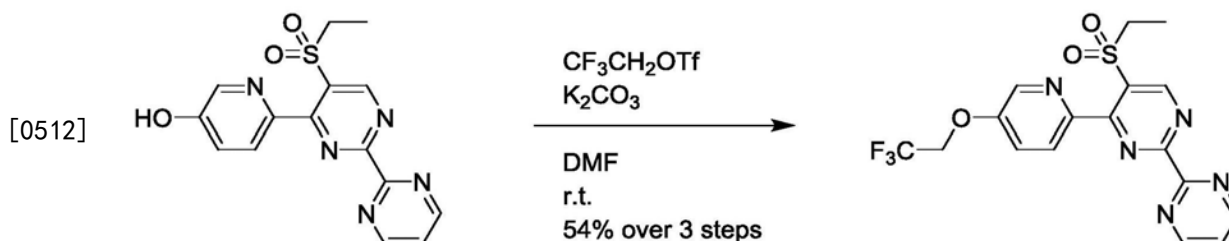
[0507] 使2-(乙基磺酰基)-1-(5-((三异丙基甲硅烷基)氧基)吡啶-2-基)乙烷-1-酮(0.5g)溶解于四氢呋喃(7ml),在室温下搅拌。向其中加入N,N-二甲基甲酰胺二甲基缩醛(0.23g),在50℃搅拌1小时。将得到的液体减压浓缩,得到的残渣无需纯化即用于下一工序。

[0508] (工序6) 6-(5-(乙基磺酰基)-[2,2'-联嘧啶]-4-基)吡啶-3-醇(6-(5-(ethylsulfonyl)-[2,2'-bipyrimidin]-4-yl) pyridin-3-ol)的合成



[0510] 使工序5中得到的3-(二甲基氨基)-2-(乙基磺酰基)-1-(5-羟基吡啶-2-基)-2-丙烯-1-酮溶解于乙醇(8ml),在室温下进行搅拌。向其中加入三乙胺(0.40g)和2-嘧啶甲脒盐酸盐(0.20g),在加热回流下搅拌1小时。将得到的液体减压浓缩,得到的残渣无需纯化即用于下一工序。

[0511] (工序7) 5-(乙基磺酰基)-4-(5-(2,2,2-三氟乙氧基)吡啶-2-基)-2,2'-联嘧啶(5-(ethylsulfonyl)-4-(5-(2,2,2-trifluoroethoxy) pyridin-2-yl)-2,2'-bipyrimidine)的合成



[0513] 将工序6中得到的6-(5-(乙基磺酰基)-[2,2'-联嘧啶]-4-基)吡啶-3-醇溶解于N,N-二甲基甲酰胺(13ml),在室温下进行搅拌。向其中加入碳酸钾(0.54g)和2,2,

2-三氟乙基三氟甲磺酸酯(0.91g),在室温下搅拌过夜。将得到的液体倒入水中,用乙酸乙酯进行萃取。将得到的有机层用饱和食盐水清洗,用无水硫酸镁干燥,进行过滤。将滤液减压浓缩,利用硅胶柱色谱对得到的残渣进行纯化,由此得到目标物0.30g(收率54%,3个工序)。

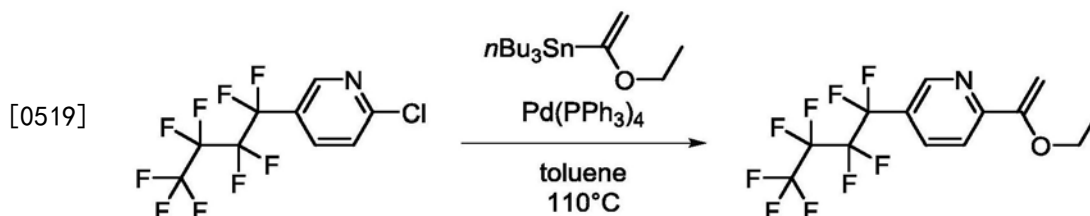
[0514] 以下示出所得的目标物的¹H-NMR。

[0515] ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃): δ9.62 (s, 1H), 9.09 (m, 2H), 8.44 (d, 1H), 8.24 (d, 1H), 7.52 (t, 1H), 7.46 (dd, 1H), 4.50 (q, 2H), 4.05 (q, 2H), 1.46 (t, 3H)。

[0516] (实施例2)

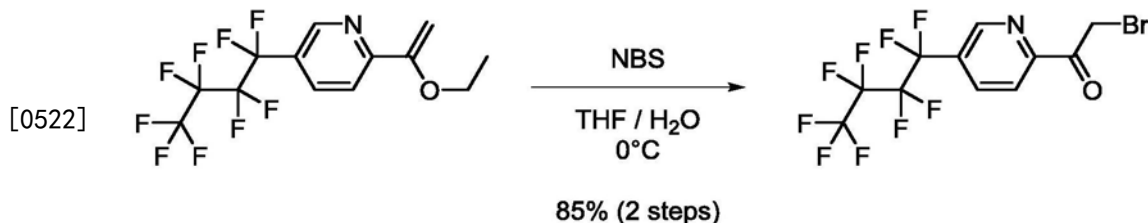
[0517] 5-(乙基磺酰基)-4-(5-(九氟丁基)吡啶-2-基)-2,2'-联嘧啶(5-(ethylsulfonyl)-4-(5-(nonafluorobutyl)pyridin-2-yl)-2,2'-bipyrimidine)(化合物编号2-3)的合成

[0518] (工序1)2-(1-乙氧基乙烯基)-5-(九氟丁基)吡啶(2-(1-ethoxyvinyl)-5-(nonafluorobutyl)pyridine)的合成



[0520] 使利用日本特开2015-86221号公报中记载的芳香族化合物的全氟烷基化反应而合成的2-氯-5-(九氟丁基)吡啶(3.3g)溶解于甲苯(20ml),将反应体系内用氩气置换,然后,在室温下进行搅拌。向其中加入三丁基(1-乙氧基乙烯基)锡(3.6g)和四(三苯基膦)钯(0)(0.58g),在110°C搅拌22小时。将得到的液体放冷至室温,进行硅藻土过滤。将滤液减压浓缩。

[0521] (工序2)2-溴-1-(5-(九氟丁基)吡啶-2-基)乙烷-1-酮(2-bromo-1-(5-(nonafluorobutyl)pyridin-2-yl)ethan-1-one)的合成

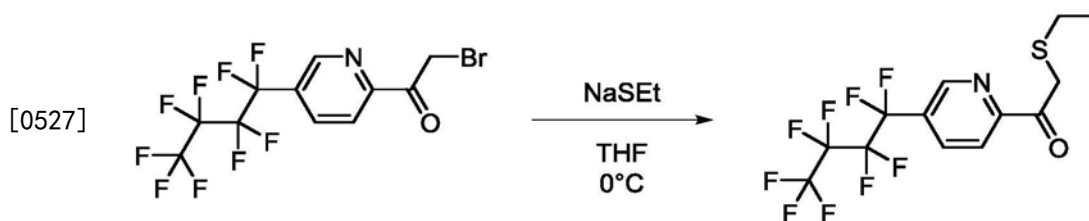


[0523] 使工序1中得到的浓缩物(含有2-(1-乙氧基乙烯基)-5-(九氟丁基)吡啶)溶解于四氢呋喃(26ml)和水(2.6ml)的混合溶剂,在0°C进行搅拌。向其中加入N-溴琥珀酰亚胺(2.1g),搅拌40分钟。将得到的液体倒入水中,用乙酸乙酯进行萃取。将得到的有机层用饱和食盐水清洗,用无水硫酸镁干燥,进行过滤。将滤液减压浓缩,利用硅胶柱色谱对得到的浓缩物进行纯化,由此得到目标物3.5g(收率85%,2个工序)。

[0524] 以下示出所得的目标物的¹H-NMR。

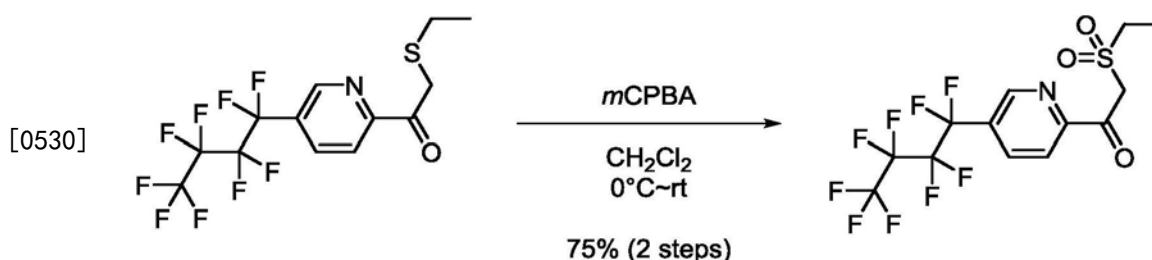
[0525] ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃): δ8.89 (d, 1H), 8.22 (d, 1H), 8.09 (dd, 1H), 4.82 (s, 2H)。

[0526] (工序3)2-(乙硫基)-1-(5-(九氟丁基)吡啶-2-基)乙烷-1-酮(2-(ethylthio)-1-(5-(nonafluorobutyl)pyridin-2-yl)ethan-1-one)的合成



[0528] 使2-溴-1-(5-(九氟丁基)吡啶-2-基)乙烷-1-酮(3.5g)溶解于四氢呋喃(25ml),在0°C进行搅拌。向其中加入乙硫醇钠(90%,0.86g),搅拌45分钟。将得到的液体倒入饱和氯化铵水溶液中,用乙酸乙酯进行萃取。将得到的有机层用饱和食盐水清洗,用无水硫酸镁干燥,进行过滤。将滤液进行减压浓缩。

[0529] (工序4) 2-(乙基磺酰基)-1-(5-(九氟丁基)吡啶-2-基)乙烷-1-酮(2-(ethylsulfonyl)-1-(5-(nonafluorobutyl)pyridin-2-yl)ethan-1-one)的合成

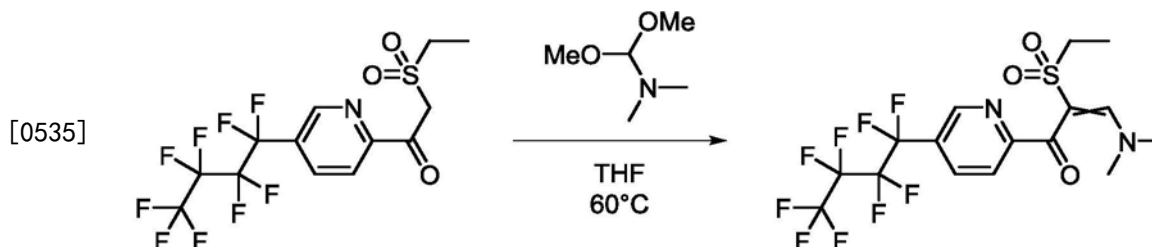


[0531] 使工序3中得到的浓缩物(含有2-(乙硫基)-1-(5-(九氟丁基)吡啶-2-基)乙烷-1-酮)溶解于二氯甲烷(43ml),在0°C进行搅拌。向其中加入间氯过氧苯甲酸(70%,4.6g),在室温下搅拌过夜。将得到的液体倒入到饱和碳酸氢钠水溶液和饱和硫代硫酸钠水溶液的混合溶液中,用氯仿进行萃取。将得到的有机层用无水硫酸镁干燥,进行过滤。对滤液进行减压浓缩,将得到的浓缩物用硅胶柱色谱进行纯化,由此得到目标物2.7g(收率75%,2个工序)。

[0532] 以下示出所得的目标物的¹H-NMR。

[0533] ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃): 8.95 (d, 1H), 8.24 (d, 1H), 8.11 (dd, 1H), 5.00 (s, 2H), 3.30 (q, 2H), 1.47 (t, 3H)。

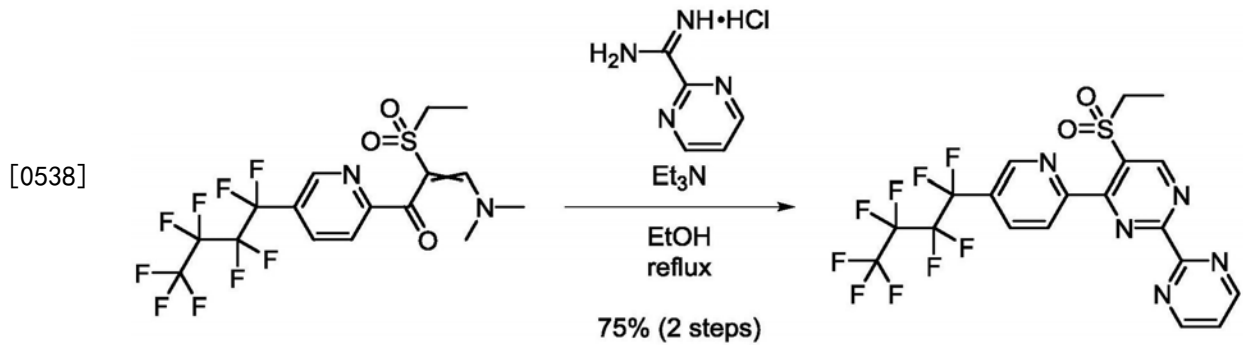
[0534] (工序5) 3-(二甲基氨基)-2-(乙基磺酰基)-1-(5-九氟丁基)吡啶-2-基)-2-丙烯-1-酮(3-(dimethylamino)-2-(ethylsulfonyl)-1-(5-(nonafluorobutyl)pyridin-2-yl)prop-2-en-1-one)的合成



[0536] 使2-(乙基磺酰基)-1-(5-(九氟丁基)吡啶-2-基)乙烷-1-酮(1.0g)溶解于四氢呋喃(12ml),在室温下进行搅拌。向其中加入N,N-二甲基甲酰胺二甲基缩醛(1.4g),在60°C搅拌100分钟。对得到的液体进行减压浓缩。

[0537] (工序6) 5-(乙基磺酰基)-4-(5-(九氟丁基)吡啶-2-基)-2,2'-联嘧啶(5-(ethylsulfonyl)-4-(5-(nonafluorobutyl)pyridin-2-yl)-2,2'-bipyrimidine)的合

成

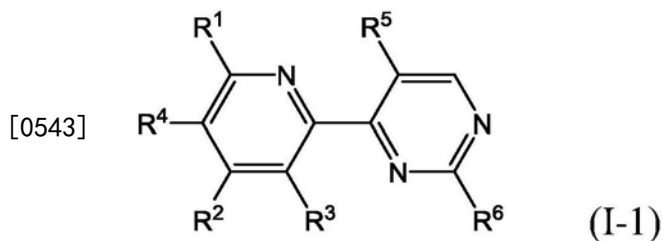


[0539] 使工序5中得到的浓缩物(含有3-(二甲基氨基)-2-(乙基磺酰基)-1-(5-九氟丁基)吡啶-2-基)-2-丙烯-1-酮) (0.20g) 溶解于乙醇 (2.1ml), 在室温下进行搅拌。向其中加入三乙胺 (0.19g) 和2-咪啶甲脒盐酸盐 (0.098g), 在加热回流下搅拌2小时。将得到的液体倒入饱和氯化铵水溶液中, 用氯仿进行萃取。将得到的有机层用无水硫酸镁干燥, 进行过滤。对滤液进行减压浓缩, 将得到的浓缩物用硅胶柱色谱进行纯化, 由此得到目标物0.17g (收率75%, 2个工序)。

[0540] 以下示出所得的目标物的¹H-NMR。

[0541] ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) : 9.65 (s, 1H) , 9.08 (d, 2H) , 8.89 (d, 1H) , 8.25 (d, 1H) , 8.15 (dd, 1H) , 7.53 (t, 1H) , 3.97 (q, 2H) , 1.45 (t, 3H) .

[0542] 将利用与上述的实施例相同的方法而制造的本发明的杂芳基咪啶化合物的例子示于第1表~第2表。第1表示出式(I-1)表示的化合物中的取代基。将化合物的物性数据记入“物性”一栏。作为物性数据, 记载了性状、熔点 (m. p.)。表中, Me表示甲基, Et表示乙基, ⁱPr表示异丙基, ^cPr表示环丙基, ^tBu表示叔丁基, Ac表示乙酰基, Ts表示对甲苯磺酰基。



[0544] [表1] 第1表

[0545]

化合物编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	物性
1-1	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	嘧啶-2-基	m.p.:119-121(°C)
1-2	H	H	H	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et	嘧啶-2-基	m.p.:165-167(°C)
1-3	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	嘧啶-2-基	m.p.:124-126(°C)
1-4	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	5-F-嘧啶-2-基	m.p.:145-147(°C)
1-5	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	苯基	m.p.:120-122(°C)
1-6	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	4-F-苯基	m.p.:149-151(°C)
1-7	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	吡啶-2-基	m.p.:145-147(°C)
1-8	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	吡啶-4-基	m.p.:146-148(°C)
1-9	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	吡啶-3-基	m.p.:137-139(°C)
1-10	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CHFCF ₃	SO ₂ Et	嘧啶-2-基	n _D (23.5°C)1.153
1-11	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Et	嘧啶-2-基	viscous oil
1-12	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Et	吡啶-2-基	m.p.:88-91(°C)
1-13	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	2-F-苯基	m.p.:99-101(°C)
1-14	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	3-F-苯基	m.p.:130-131(°C)
1-15	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	1-(CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SiMe ₃)- 1H-1,2,4-三唑-3-基	m.p.:115-117(°C)
1-16	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	1-Me-1H-1,2,4-三唑- 5-基	m.p.:126-128(°C)
1-17	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	1-(CHF ₂)-1H-1,2,4- 三唑-3-基	m.p.:87-89(°C)
1-18	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	1-Ac-1H-1,2,4-三唑- 3-基	m.p.:66-69(°C)
1-19	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	1H-1,2,4-三唑-3-基	m.p.:138-140(°C)
1-20	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	1-(CHF ₂)-1H-1,2,4- 三唑-3-基	m.p.:72-75(°C)

[0546]

[表2]

第1表(续)

[0547]

化合物编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	物性
1-21	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	1-Me-1H-1, 2, 4-三唑-5-基	m.p.: 94-97 (°C)
1-22	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	1-Et-1H-1, 2, 4-三唑-5-基	m.p.: 96-99 (°C)
1-23	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	1-Me-1H-1, 2, 4-三唑-3-基	m.p.: 213-216 (°C)
1-24	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	1-(CH ₂ CF ₃)-1H-1,2,4-三唑-5-基	m.p.: 141-143 (°C)
1-25	H	H	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ Et	1-Me-1H-1, 2, 4-三唑-3-基	m.p.: 75-78 (°C)
1-26	H	H	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ Et	1-Me-1H-1, 2, 4-三唑-3-基	m.p.: 69-72 (°C)
1-27	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	1-Me-1H-1, 2, 4-三唑-3-基	m.p.: 162-163 (°C)
1-28	H	H	H	4-[1H-pyrazol-1-yl]	SO ₂ Et	吡啶-2-基	m.p.: 253-255 (°C)
1-29	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	1-(CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SiMe ₃)-1H-1, 2, 4-三唑-3-基	非晶
1-30	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	NH ₂	m.p.: 163-165 (°C)
1-31	H	H	H	4-(CF ₂ CF ₃)-1H-pyrazol-1-yl	SO ₂ Et	吡啶-2-基	m.p.: 145-149 (°C)
1-32	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	NH ₂	m.p.: 163-165 (°C)
1-33	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	1H-1, 2, 4-三唑-3-基	m.p.: 136-138 (°C)
1-34	H	H	H	4-(CH=CH ₂)-1H-pyrazol-1-yl	SO ₂ Et	吡啶-2-基	m.p.: 206-211 (°C)
1-35	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	Me	m.p.: 84-86 (°C)
1-36	H	H	H	CH=CCl ₂	SO ₂ Et	吡啶-2-基	m.p.: 198-199 (°C)
1-37	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	1-(CH ₂ ^o Pr)-1H-1, 2, 4-三唑-5-基	m.p.: 103-105 (°C)
1-38	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	1-(CH ₂ ^o Pr)-1H-1, 2, 4-三唑-3-基	粘稠油
1-39	H	H	H	SEt	SEt	1-Me-1H-1, 2, 4-三唑-3-基	m.p.: 163-165 (°C)
1-40	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SEt	1-Me-1H-1, 2, 4-三唑-3-基	m.p.: 139-141 (°C)

[0548]

[表3]

第1表(续)

[0549]

化合物编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	物性
1-41	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	1-Me-1H-1, 2, 4-三唑-3-基	m.p.:133-136(°C)
1-42	H	H	H	SO ₂ Et	SO ₂ Et	1-Me-1H-1, 2, 4-三唑-3-基	非晶
1-43	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	Et	m.p.:89-91(°C)
1-44	H	H	H	benzyloxy	SO ₂ Et	NH ₂	m.p.:177-182(°C)
1-45	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	5-NH ₂ -1H-1, 2, 4-三唑-1-基	m.p.:210-215(°C)
1-46	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	3-NH ₂ -1H-1, 2, 4-三唑-1-基	m.p.:240-244(°C)
1-47	H	H	H	CH=NOCH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	吡啶-2-基	m.p.:143-145(°C)
1-48	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	OMe	m.p.:116-118(°C)
1-49	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	3-NH ₂ -1H-1, 2, 4-三唑-1-基	m.p.:255-257(°C)
1-50	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	5-NH ₂ -1H-1, 2, 4-三唑-1-基	m.p.:255-257(°C)
1-51	H	H	H	benzyloxy	SO ₂ Et	吡啶-2-基	m.p.:156-158(°C)
1-52	H	H	H	OSO ₂ CF ₃	SO ₂ Et	吡啶-2-基	m.p.:154-156(°C)
1-53	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CHFCF ₃	SO ₂ Et	OMe	m.p.:145-147(°C)
1-54	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CHFCF ₃	SO ₂ Et	NH ₂	m.p.:161-163(°C)
1-55	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CHFCF ₃	SO ₂ Et	3-NH ₂ -1H-1, 2, 4-三唑-1-基	m.p.:242-244(°C)
1-56	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CHFCF ₃	SO ₂ Et	5-NH ₂ -1H-1, 2, 4-三唑-1-基	m.p.:242-244(°C)
1-57	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Et	OMe	m.p.:109-111(°C)
1-58	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Et	NH ₂	m.p.:148-150(°C)
1-59	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Et	OMe	m.p.:144-146(°C)
1-60	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Et	NH ₂	m.p.:154-156(°C)

[0550]

[表4]

第1表(续)

[0551]

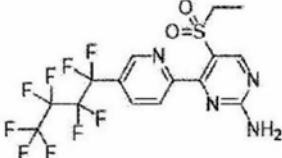
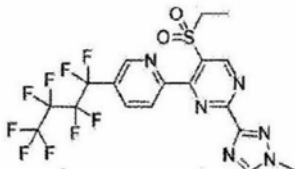
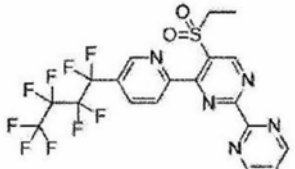
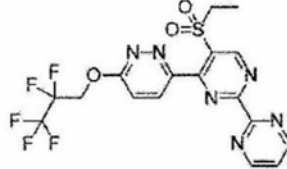
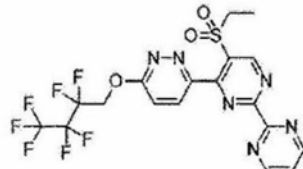
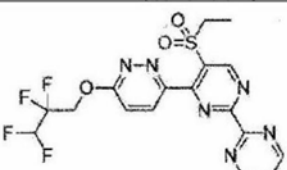
化合物编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	物性
1-61	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	NHAc	m.p.:151-153(°C)
1-62	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	NMe ₂	m.p.:141-144(°C)
1-63	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	Cl	m.p.:127-128(°C)
1-64	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	NMeNH ₂	m.p.:120-123(°C)
1-65	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	NHNH ₂	m.p.:177-179(°C)
1-66	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	NHCONHMe	m.p.:96-100(°C)
1-67	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	NHCO ^o Pr	m.p.:151-153(°C)
1-68	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	OCH ₂ ^o Pr	n _D (20.7°C)1.504
1-69	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	CN	m.p.:122-123(°C)
1-70	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	OCH ₂ CF ₃	m.p.:139-141(°C)
1-71	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	NHCOO ^t Bu	m.p.:169-171(°C)
1-72	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	NHSO ₂ NMe ₂	m.p.:186-188(°C)
1-73	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	NHNHTs	viscous oil
1-74	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	NHAc	m.p.:182-184(°C)
1-75	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	NHMe	m.p.:144-147(°C)
1-76	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	CONH ₂	viscous oil
1-77	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	NHSO ₂ CF ₃	m.p.:294-295(°C)
1-78	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	NHCOCH ₂ CH ₃	m.p.:167-168(°C)
1-79	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	NHCO ^o Pr	m.p.:183-184(°C)
1-80	H	H	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	NHCOCF ₃	m.p.:157-158(°C)
1-81	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	3-NH ₂ -1H-1, 2, 4-三唑-1-基	m.p.:280-282(°C)
1-82	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ Et	5-NH ₂ -1H-1, 2, 4-三唑-1-基	m.p.:222-224(°C)

[0552]

[表5]

第2表

[0553]

化合物编号	结构式	物性
2-1		m.p.: 222-224(°C)
2-2		m.p.: 171-173(°C)
2-3		m.p.: 132-134(°C)
2-4		m.p.: 111-113(°C)
2-5		m.p.: 115-117(°C)
2-6		m.p.: 216-217(°C)

[0554]

[表6]

第2表(续)

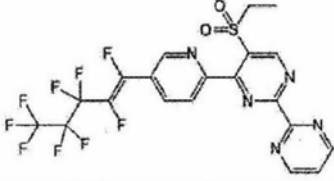
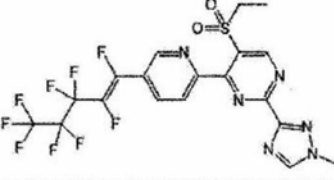
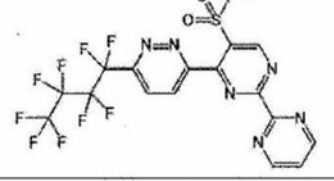
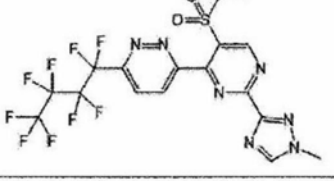
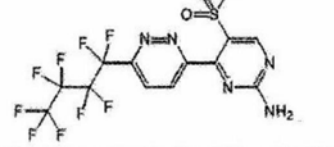
[0555]

化合物编号	结构式	物性
2-7		m.p.: 177-179 (°C)
2-8		m.p.: 209-210 (°C)
2-9		m.p.: 191-192 (°C)
2-10		m.p.: 95-97 (°C)
2-11		m.p.: 212-214 (°C)
2-12		m.p.: 234-239 (°C)

[0556]

[表7]

第2表(续)

化合物编号	结构式	物性
2-13		m.p.: 138-140(°C)
2-14		m.p.: 174-176(°C)
[0557] 2-15		m.p.: 170-173(°C)
2-16		m.p.: 182-185(°C)
2-17		m.p.: 186-188(°C)

[0558] 以下示出第1表和第2表所示出的化合物中物性为粘稠油状或非晶的化合物的¹H-NMR数据。

[0559] 化合物编号(1-11):¹H-NMR(400MHz,CDCl₃):δ9.59(s,1H),9.06(d,2H),8.41(d,1H),8.22(d,1H),7.50(t,1H),7.43(dd,1H),5.17(m,1H),4.47(m,1H),4.01(q,2H),1.43(t,3H).

[0560] 化合物编号(1-29):¹H-NMR(400MHz,CDCl₃)δ:9.52(1H,s),8.47(1H,s),8.43(1H,d,J=3.2Hz),8.26(1H,d,J=9.1Hz),7.45(1H,dd,J=8.8,2.9Hz),5.68(2H,s),4.60(2H,t,J=12.5Hz),4.04(2H,q,J=7.4Hz),3.71(2H,t,J=8.4Hz),1.45(3H,t,J=7.5Hz),0.96(2H,t,J=8.4Hz),-0.01(9H,s).

[0561] 化合物编号(1-38):¹H-NMR(400MHz,CDCl₃):δ9.51(s,1H),8.42(d,1H),8.39(s,1H),8.26(d,1H),7.44(dd,1H),4.57(t,2H),4.21(d,2H),4.03(q,2H),1.50-1.41(m,4H),0.80-0.75(m,2H),0.51-0.47(m,2H).

[0562] 化合物编号(1-42):¹H-NMR(400MHz,CDCl₃):δ9.55(s,1H),9.14(d,1H),8.41(dd,1H),8.30(d,1H),8.28(s,1H),4.12(s,3H),3.94(q,2H),3.22(q,2H),1.46(t,3H),1.37(t,3H).

[0563] 化合物编号(1-73):¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆,140°C):δ9.89(s,1H),9.45(s,

1H), 8.64 (s, 1H), 8.44 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.68 (dd, 1H), 7.63 (d, 2H), 7.09 (d, 2H), 4.99 (t, 2H), 3.70 (q, 2H), 2.24 (s, 3H), 1.21 (t, 3H).

[0564] 化合物编号(1-76): ¹H-NMR (400MHz, CDC13): δ9.50 (s, 1H), 8.46 (d, 1H), 8.24 (d, 1H), 7.88 (brs, 1H), 7.50 (dd, 1H), 6.94 (d, 1H), 4.65 (t, 2H), 4.06 (q, 2H), 1.45 (t, 3H).

[0565] (生物试验)

[0566] 在以下的试验例中显示本发明的杂芳基嘧啶化合物作为有害生物防除剂和体外寄生虫防除剂的有效成分是有用的。“份”为重量基准。

[0567] (试验用乳剂的制备)

[0568] 将本发明杂芳基嘧啶化合物5份、二甲基甲酰胺93.6份和聚氧乙烯烷基芳基醚1.4份混合溶解, 制备有效成分5%的乳剂(I)。

[0569] 为了进行对照, 将二甲基甲酰胺98.5份和聚氧乙烯烷基芳基醚1.5份混合溶解而制备乳剂(II)。

[0570] 杀虫率通过下述公式进行计算。

[0571] 杀虫率(%) = (死亡虫数/受试虫数) × 100

[0572] (试验例1) 对粘虫的效力试验

[0573] 将市售的人工饲料(Insecta LFS, 日本农产工业公司制) 0.8g与乳剂(I) 1μl充分混合而得到试验用饲料。

[0574] 在塑料制试验容器(1.4ml容量)中, 向各处理区分别装入0.2g的试验用饲料。接着, 向各处理区分别接种2只粘虫2龄幼虫。将塑料制的盖放在试验容器上来避免粘虫2龄幼虫逃出。将其放置于25℃的恒温室内, 在第5天对杀虫率和摄食量进行调查。试验重复进行2次。

[0575] 作为对照区, 将乳剂(I) 变更为乳剂(II), 除此以外, 利用与试验例1相同的方法来调查杀虫率和摄食量。

[0576] 针对第3表中示出的化合物编号的化合物进行对粘虫的效力试验。任一化合物对粘虫的杀虫率均为100%或者摄食量与对照区相比为10%以下。可知本发明杂芳基嘧啶化合物对粘虫有效。

[0577] [表8] 第3表

[0578]	1-1	1-20	1-47	1-67	2-9
	1-3	1-21	1-48	1-68	2-10
	1-4	1-24	1-49	1-78	2-13
	1-6	1-25	1-50	1-79	2-14
	1-7	1-27	1-54	1-80	2-15
	1-8	1-30	1-58	2-1	
	1-12	1-32	1-61	2-2	
	1-13	1-35	1-62	2-3	
	1-16	1-43	1-64	2-4	
	1-18	1-44	1-65	2-5	
	1-19	1-45	1-66	2-7	

[0579] (试验例2) 对豆蚜的效力试验

[0580] 在3寸盆中培育豇豆苗, 在初生叶上接种豆蚜若虫。以本发明化合物为125ppm的方式用水对乳剂(I) 进行稀释, 将上述稀释液散布在豆蚜若虫寄生的豇豆上。将上述豇豆放置

在温度25℃、湿度60%的恒温室内。从散布经过4天时进行豆蚜的生死判定,算出杀虫率。试验反复进行2次。

[0581] 针对第4表中示出的化合物编号的化合物进行对豆蚜的效力试验。任一化合物都对豆蚜表现出80%以上的杀虫率。

[0582] [表9]

[0583] 第4表

[0584]	1-1	1-25	1-62	2-4
	1-2	1-29	1-65	2-5
	1-9	1-32	1-78	2-6
	1-11	1-33	1-80	2-9
	1-15	1-35	2-2	2-10
	1-21	1-61	2-3	

[0585] (试验例3) 对小菜蛾的效力试验

[0586] 以本发明化合物的浓度为125ppm的方式用水对乳剂(I)进行稀释。将卷心菜叶在上述稀释液中浸渍30秒。将该卷心菜叶放入培养皿中。向其中投放5只小菜蛾2龄幼虫。将培养皿放置于温度25℃、湿度60%的恒温室内。从放虫起经过3天时进行生死判定,算出杀虫率。试验重复进行2次。

[0587] 针对第5表中示出的化合物编号的化合物进行对小菜蛾的效力试验。任一化合物都对小菜蛾表现出80%以上的杀虫率。

[0588] [表10]

[0589] 第5表

[0590]	1-1	1-20	1-45	1-69	2-1
	1-3	1-21	1-48	1-71	2-2
	1-4	1-22	1-50	1-74	2-3
	1-7	1-24	1-58	1-75	2-5
	1-8	1-27	1-61	1-78	2-13
	1-12	1-30	1-62	1-79	
	1-13	1-35	1-66	1-80	
	1-16	1-37	1-67	1-81	
	1-17	1-43	1-68	1-82	

[0591] (试验例4) 对黄曲条跳甲的效力试验

[0592] 以本发明化合物为125ppm的方式用水对乳剂(I)进行稀释,制备试验用药液。将上述试验用药液散布到在3寸盆中种植的青梗菜苗(第7片叶展开期)上。使青梗菜苗风干,接着装入塑料杯中。向其中投放10只黄曲条跳甲(*Phyllotreta striolata*)成虫。在温度25℃、湿度65%的恒温室内保存,从放虫起7天后进行生死判定,算出杀虫率。试验重复进行2次。

[0593] 针对第6表中示出的化合物编号的化合物进行对黄曲条跳甲成虫的效力试验。任一化合物都对黄曲条跳甲成虫表现出80%以上的杀虫率。

[0594] [表11]

[0595] 第6表

[0596]	1-1	1-22	1-50	2-2
	1-3	1-27	1-54	2-3
	1-16	1-30	1-61	
	1-20	1-45	1-67	
	1-21	1-49	2-1	

[0597] (试验例5)对褐飞虱的效力试验

[0598] 以本发明化合物的浓度为125ppm的方式用水对乳剂(I)进行稀释。将水稻幼苗在上述稀释液中浸渍30秒。使水稻幼苗风干,接着装入塑料盒中。向其中投放5只褐飞虱2龄幼虫。在温度25℃、湿度65%的恒温室内保存,从接种起7天后进行生死判定,算出杀虫率。试验重复进行2次。

[0599] 针对第7表中示出的化合物编号的化合物进行对褐飞虱的效力试验。任一化合物都对褐飞虱表现出80%以上的杀虫率。

[0600] [表12]

[0601] 第7表

[0602]	1-1	1-21	1-45	2-4
	1-2	1-22	1-46	2-5
	1-3	1-23	1-48	2-6
	1-7	1-27	1-50	2-7
	1-11	1-35	1-61	2-9
	1-16	1-37	2-2	
	1-17	1-41	2-3	

[0603] 从本发明的杂芳基嘧啶化合物中随机选择的化合物都起到了如上所述的效果,因此可以理解为本发明的杂芳基嘧啶化合物包括未完全例示的化合物在内都是具有有害生物防除、特别是杀螨、杀虫等效果的化合物。另外,可以理解为是对体外寄生虫等危害人畜的寄生虫也有效果的化合物。

[0604] 产业上的可利用性

[0605] 本发明的杂芳基嘧啶化合物能够防除在农作物、卫生方面成为问题的有害生物。尤其能够以更低的浓度有效地防除农业害虫和螨类。此外,能够有效地防除危害人畜的体外寄生虫和体内寄生虫。