



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 101754950 B

(45) 授权公告日 2013. 05. 29

(21) 申请号 200880025212. 8

C07C 323/65 (2006. 01)

(22) 申请日 2008. 05. 16

A01N 41/10 (2006. 01)

(30) 优先权数据

2007-132612 2007. 05. 18 JP

(56) 对比文件

JP 2005179321 A, 2005. 07. 07, 全文.

(85) PCT申请进入国家阶段日

2010. 01. 18

审查员 刘杰

(86) PCT申请的申请数据

PCT/JP2008/059491 2008. 05. 16

(87) PCT申请的公布数据

W02008/143332 EN 2008. 11. 27

(73) 专利权人 住友化学株式会社

地址 日本东京都

(72) 发明人 宫崎裕之

(74) 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公

司 72001

代理人 梁谋 李连涛

(51) Int. Cl.

C07C 317/44 (2006. 01)

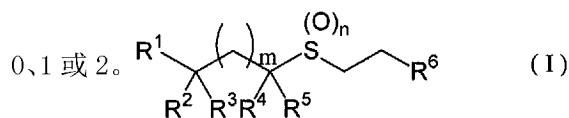
权利要求书1页 说明书84页

(54) 发明名称

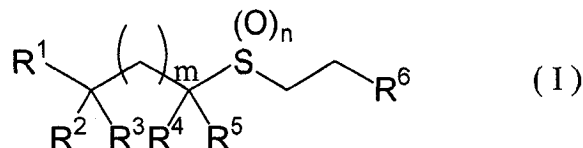
有机硫化合物及其防治有害节肢动物的用途

(57) 摘要

本发明提供由式 (I) 表示的有机硫化合物, 所述化合物对有害节肢动物具有优良的防治效果。式 (I) 中, R^1 表示具有至少一个氟原子的 C1-C5 卤代烷基, R^2 表示被至少一个卤素原子任选取代的 C1-C4 烷基等, R^3 表示氢原子等, R^4 表示氰基等, R^5 表示氢原子等, m 表示 1-4 的整数, n 表示



1. 一种由下式 (I) 表示的有机硫化合物：



其中，

R^1 表示具有至少一个氟原子的 C1-C5 卤代烷基，

R^2 表示 C1-C4 烷基、C1-C4 烷氧基或 C1-C4 烷硫基，

R^3 表示氢原子、卤素原子或 C1-C4 烷基，

R^4 表示氰基、 $\text{C}(=\text{Q})\text{OR}^7$ 或 $\text{C}(=\text{Q})\text{N}(\text{R}^8)_2$ ，

R^5 表示氢原子、卤素原子或 C1-C4 烷基，

R^6 表示 C1-C5 氟代烷基，

Q 表示氧原子或硫原子，

R^7 表示 C1-C4 烷基，

每个 R^8 独立表示氢原子，

m 表示 1-4 的整数，

n 表示 2。

2. 权利要求 1 的有机硫化合物，其中 Q 为氧原子。

3. 权利要求 1 的有机硫化合物，其中 R^4 为氰基。

4. 权利要求 1 的有机硫化合物，其中 R^4 为 $\text{C}(=\text{Q})\text{N}(\text{R}^8)_2$ ， R^8 为氢原子。

5. 权利要求 1-4 中任一项的有机硫化合物，其中 R^5 为卤素原子。

6. 权利要求 1-4 中任一项的有机硫化合物，其中 m 为 2。

7. 一种杀虫组合物，所述杀虫组合物包含权利要求 1-6 中任一项的有机硫化合物作为活性成分。

8. 一种用于防治有害节肢动物的方法，该方法包括将有效量的权利要求 1-6 中任一项的有机硫化合物应用于有害节肢动物或有害节肢动物栖息的地方。

9. 权利要求 1-6 中任一项的有机硫化合物在制备杀虫组合物中的用途。

有机硫化合物及其防治有害节肢动物的用途

技术领域

[0001] 本发明涉及有机硫化合物及其用于防治有害节肢动物的用途。

背景技术

[0002] 迄今为止,已经开发出许多用于防治有害节肢动物的杀虫组合物并已用于实际应用。此外,JP-A 2004-130306 公开了某种含氟有机硫化合物。

发明内容

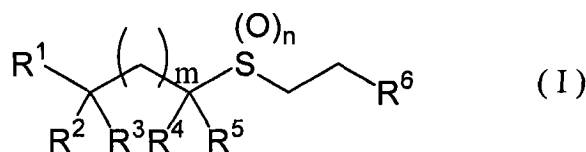
[0003] 本发明的目的是提供具有对有害节肢动物具有优良防治效果的新的化合物及其用途。

[0004] 本发明的发明人为了找出对有害节肢动物具有优良防治效果的化合物进行了深入研究,结果,发现了由下式 (I) 表示的有机硫化合物对有害昆虫和有害螨虫等有害节肢动物具有优良的防治效果。由此完成了本发明。

[0005] 也就是说,本发明提供:

[0006] (1) 由下式 (I) 表示的有机硫化合物(下文有时亦称本发明的化合物):

[0007]



[0008] 其中,

[0009] R^1 表示具有至少一个氟原子的 C1-C5 卤代烷基,

[0010] R^2 表示被至少一个卤素原子任选取代的 C1-C4 烷基、被至少一个卤素原子任选取代的 C1-C4 烷氧基或被至少一个卤素原子任选取代的 C1-C4 烷硫基,

[0011] R^3 表示氢原子、卤素原子或 C1-C4 烷基,

[0012] R^4 表示氰基、 $\text{C}(=\text{Q})\text{OR}^7$ 或 $\text{C}(=\text{Q})\text{N}(\text{R}^8)_2$,

[0013] R^5 表示氢原子、卤素原子或 C1-C4 烷基,

[0014] R^6 表示 C1-C5 氟代烷基,

[0015] Q 表示氧原子或硫原子,

[0016] R^7 表示 C1-C4 烷基,

[0017] 每个 R^8 独立表示氢原子或 C1-C4 烷基,或者两个 R^8 在其末端彼此连接形成 C2-C7 亚烷基,

[0018] m 表示 1-4 的整数,

[0019] n 表示 0、1 或 2;

[0020] (2) 上述 (1) 的有机硫化合物,其中 n 为 2;

[0021] (3) 上述 (1) 或 (2) 的有机硫化合物,其中 Q 为氧原子;

[0022] (4) 上述 (1) 或 (2) 的有机硫化合物,其中 R^4 为氰基;

[0023] (5) 上述 (1) 或 (2) 的有机硫化合物, 其中 R^4 为 $C(=Q)N(R^8)_2$, 每个 R^8 独立地为氢原子或 C1-C4 烷基;

[0024] (6) 上述 (1) 或 (2) 的有机硫化合物, 其中 R^4 为 $C(=Q)N(R^8)_2$, R^8 为氢原子;

[0025] (7) 上述 (1)-(6) 中任一项的有机硫化合物, 其中 R^5 为卤素原子;

[0026] (8) 上述 (1)-(7) 中任一项的有机硫化合物, 其中 m 为 2;

[0027] (9) 一种杀虫组合物, 所述杀虫组合物包含上述 (1)-(8) 中任一项的有机硫化合物作为活性成分;

[0028] (10) 一种用于防治有害节肢动物的方法, 该方法包括将有效量的上述 (1)-(8) 中任一项的有机硫化合物用于有害节肢动物或有害节肢动物栖息的地方;

[0029] (11) 上述 (1)-(8) 中任一项的有机硫化合物在制备杀虫组合物中的用途; 等等。

[0030] 实施本发明的最佳方式

[0031] 在本发明中, 术语“C1-C4”等是指构成取代基的碳原子总数。

[0032] 式 (I) 中由 R^1 表示的“具有至少一个氟原子的 C1-C5 卤代烷基”的实例包括 C1-C2 卤代烷基, 例如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、溴二氟甲基、氯二氟甲基、1-氟乙基、1,1-二氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,1,2,2-四氟乙基和 1,1,2,2,2-五氟乙基; C3 卤代烷基, 例如 1-氟丙基、1,1-二氟丙基、2-氟丙基、2,2-二氟丙基、3-氟丙基、3,3-二氟丙基、3,3,3-三氟丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基和 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基; C4 卤代烷基, 例如 1-氟丁基、1,1-二氟丁基、2-氟丁基、2,2-二氟丁基、3-氟丁基、3,3-二氟丁基、4-氟丁基、4,4-二氟丁基、4,4,4-三氟丁基、3,3,4,4,4-五氟丁基、2,2,3,3,4,4,4-七氟丁基和 1,1,2,2,3,3,4,4,4-九氟丁基; 以及 C5 卤代烷基, 例如 1-氟戊基、1,1-二氟戊基、2-氟戊基、2,2-二氟戊基、3-氟戊基、3,3-二氟戊基、4-氟戊基、4,4-二氟戊基、5-氟戊基、5,5-二氟戊基、5,5,5-三氟戊基、4,4,5,5,5-五氟戊基、3,3,4,4,5,5,5-七氟戊基、2,2,3,3,4,4,5,5,5-九氟戊基和 1,1,2,2,3,3,4,4,5,5,5-十一氟戊基。

[0033] 式 (I) 中由 R^6 表示的“C1-C5 氟代烷基”的实例包括 C1-C2 氟代烷基, 例如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、1,1-二氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基和 1,1,2,2,2-五氟乙基; C3 氟代烷基, 例如 1-氟丙基、1,1-二氟丙基、2-氟丙基、2,2-二氟丙基、3-氟丙基、3,3-二氟丙基、3,3,3-三氟丙基、1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、2,2,2-三氟-(1-三氟甲基)乙基、1,2,2,2-四氟-(1-三氟甲基)乙基和 2,2,3,3-四氟丙基; C4 氟代烷基, 例如 1-氟丁基、1,1-二氟丁基、2-氟丁基、2,2-二氟丁基、3-氟丁基、3,3-二氟丁基、4-氟丁基、4,4-二氟丁基、4,4,4-三氟丁基、3,3,4,4,4-五氟丁基、2,2,3,4,4-五氟丁基和 2,2,3,3,4,4,4-七氟丁基; C5 氟代烷基, 例如 1-氟戊基、1,1-二氟戊基、2-氟戊基、2,2-二氟戊基、3-氟戊基、3,3-二氟戊基、4-氟戊基、4,4-二氟戊基、5-氟戊基、5,5-二氟戊基、5,5,5-三氟戊基、4,4,5,5,5-五氟戊基、3,3,4,4,5,5,5-七氟戊基、2,2,3,3,4,4,5,5-八氟戊基和 2,2,3,3,4,4,5,5,5-九氟戊基。

[0034] 在本发明中, “C1-C5 氟代烷基”的优选实例包括由下式表示的基团:

[0035] $(CH_2)_r-C_tF_{(2t+1)}$

[0036] 其中 r 表示 0-4 的整数, t 表示 1-3 的整数, 条件是 $r+t \leq 5$ 。

[0037] 式 (I) 中由 R^2 表示的“被至少一个卤素原子任选取代的 C1-C4 烷基”的实例包括甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、叔丁基、氟甲基、氯甲基、溴甲基、二氟甲基、三氟甲

基和三氯甲基。

[0038] 式 (I) 中由 R^2 表示的“被至少一个卤素原子任选取代的 C1-C4 烷氧基”的实例包括甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基和三氟甲氧基。

[0039] 式 (I) 中由 R^2 表示的“被至少一个卤素原子任选取代的 C1-C4 烷硫基”的实例包括甲硫基、乙硫基、丙硫基、异丙硫基、丁硫基、异丁硫基、叔丁硫基和三氟甲硫基。

[0040] 式 (I) 中由 R^3 表示的“C1-C4 烷基”的实例包括甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基和叔丁基。

[0041] 式 (I) 中由 R^5 表示的“C1-C4 烷基”的实例包括甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基和叔丁基。

[0042] 式 (I) 中由 R^7 表示的“C1-C4 烷基”的实例包括甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基和叔丁基。

[0043] 式 (I) 中由 R^8 表示的“C1-C4 烷基”的实例包括甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基和叔丁基。

[0044] 通过两个 R^8 在其末端结合所形成的“C2-C7 亚烷基”的实例包括 1,2-亚乙基、1,3-亚丙基、1,4-亚丁基和 1,6-亚己基。

[0045] 由 $N(R^6)_2$ 表示的基团的实例包括无环氨基,例如氨基、甲基氨基、乙基氨基、丙基氨基、2-丙基氨基、丁基氨基、异丁基氨基、叔丁基氨基和二甲基氨基;以及环状氨基,例如 1-氮杂环丙烷基 (1-aziridino group)、1-氮杂环丁烷基、1-吡咯烷基和哌啶子基。

[0046] 本发明化合物的具体实例包括:

[0047] 由式 (I) 表示的有机硫化合物,其中 n 为 2;

[0048] 由式 (I) 表示的有机硫化合物,其中 Q 为氧原子;

[0049] 由式 (I) 表示的有机硫化合物,其中 R^4 为氰基;

[0050] 由式 (I) 表示的有机硫化合物,其中 R^4 为 $C(=Q)OR^7$ 或 $C(=Q)N(R^8)_2$;

[0051] 由式 (I) 表示的有机硫化合物,其中 R^4 为 $C(=Q)N(R^8)_2$,每个 R^8 独立地为氢原子或 C1-C4 烷基;

[0052] 由式 (I) 表示的有机硫化合物,其中 R^4 为 $C(=Q)N(R^8)_2$, R^8 为氢原子;

[0053] 由式 (I) 表示的有机硫化合物,其中 m 为 2;

[0054] 由式 (I) 表示的有机硫化合物,其中 R^1 为三氟甲基、1,1,2,2,2-五氟乙基或 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基;

[0055] 由式 (I) 表示的有机硫化合物,其中 R^1 为三氟甲基;

[0056] 由式 (I) 表示的有机硫化合物,其中 R^1 为 1,1,2,2,2-五氟乙基;

[0057] 由式 (I) 表示的有机硫化合物,其中 R^1 为 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基;

[0058] 由式 (I) 表示的有机硫化合物,其中 R^2 为甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、甲氧基或甲硫基;

[0059] 由式 (I) 表示的有机硫化合物,其中 R^2 为甲基、乙基、甲氧基或甲硫基;

[0060] 由式 (I) 表示的有机硫化合物,其中 R^2 为甲基;

[0061] 由式 (I) 表示的有机硫化合物,其中 R^2 为乙基;

[0062] 由式 (I) 表示的有机硫化合物,其中 R^2 为丙基;

[0063] 由式 (I) 表示的有机硫化合物,其中 R^2 为异丙基;

- [0064] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^2 为叔丁基;
- [0065] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^2 为甲氧基;
- [0066] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^2 为甲硫基;
- [0067] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^3 为氢原子或甲基;
- [0068] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^3 为氢原子;
- [0069] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^3 为甲基;
- [0070] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^5 为氢原子;
- [0071] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^5 为卤素原子;
- [0072] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^5 为氟原子或氯原子;
- [0073] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^5 为甲基;
- [0074] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^6 为由下式表示的基团:
- [0075] $(CH_2)_r-C_tF_{(2t+1)}$
- [0076] 其中 r 表示 0-4 的整数, t 表示 1-3 的整数, 条件是 $r+t \leq 5$;
- [0077] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^6 为 C1-C3 氟代烷基;
- [0078] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^6 为三氟甲基、1,1,2,2,2-五氟乙基、2,2,2-三氟乙基或 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基;
- [0079] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^6 为三氟甲基;
- [0080] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^6 为 1,1,2,2,2-五氟乙基;
- [0081] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^6 为 2,2,2-三氟乙基;
- [0082] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^6 为 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基;
- [0083] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^2 为甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、甲氧基或甲硫基, R^3 为氢原子或甲基;
- [0084] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^2 为甲基、乙基、甲氧基或甲硫基, R^3 为氢原子或甲基;
- [0085] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^2 为甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、甲氧基或甲硫基, R^3 为氢原子;
- [0086] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^2 为甲基、乙基、甲氧基或甲硫基, R^3 为氢原子;
- [0087] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^2 为甲基、乙基、丙基、异丙基或叔丁基, R^3 为氢原子;
- [0088] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^2 为甲基或乙基, R^3 为氢原子;
- [0089] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^2 为甲氧基或甲硫基, R^3 为氢原子;
- [0090] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 Q 为氧原子, R^5 为氢原子;
- [0091] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 Q 为氧原子, R^5 为卤素原子;
- [0092] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 Q 为氧原子, R^5 为氟原子或氯原子;
- [0093] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 Q 为氧原子, R^5 为甲基;
- [0094] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^4 为氰基, R^5 为氢原子;
- [0095] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^4 为氰基, R^5 为卤素原子;
- [0096] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^4 为氰基, R^5 为氟原子或氯原子;

- [0097] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^4 为氰基, R^5 为甲基;
- [0098] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^4 为 $C(=Q)N(R^8)_2$, R^5 为氢原子;
- [0099] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^4 为 $C(=Q)N(R^8)_2$, R^5 为卤素原子;
- [0100] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^4 为 $C(=Q)N(R^8)_2$, R^5 为氟原子或氯原子;
- [0101] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^4 为 $C(=Q)N(R^8)_2$, R^5 为甲基;
- [0102] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^4 为 $C(=Q)N(R^8)_2$, R^5 为氢原子, R^8 为氢原子;
- [0103] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^4 为 $C(=Q)N(R^8)_2$, R^5 为卤素原子, R^8 为氢原子;
- [0104] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^4 为 $C(=Q)N(R^8)_2$, R^5 为氟原子或氯原子, R^8 为氢原子;
- [0105] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^4 为 $C(=Q)N(R^8)_2$, R^5 为甲基, R^8 为氢原子;
- [0106] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, R^4 为氰基, R^5 为氢原子;
- [0107] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, R^4 为氰基, R^5 为卤素原子;
- [0108] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, R^4 为氰基, R^5 为氟原子或氯原子;
- [0109] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, R^4 为氰基, R^5 为甲基;
- [0110] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, R^4 为 $C(=Q)N(R^8)_2$, R^5 为氢原子, R^8 为氢原子;
- [0111] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, R^4 为 $C(=Q)N(R^8)_2$, R^5 为卤素原子, R^8 为氢原子;
- [0112] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, R^4 为 $C(=Q)N(R^8)_2$, R^5 为氟原子或氯原子, R^8 为氢原子;
- [0113] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, R^4 为 $C(=Q)N(R^8)_2$, R^5 为甲基, R^8 为氢原子;
- [0114] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^4 为氰基, R^5 为氢原子;
- [0115] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^4 为氰基, R^5 为卤素原子;
- [0116] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^4 为氰基, R^5 为氟原子或氯原子;
- [0117] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^4 为氰基, R^5 为甲基;
- [0118] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^4 为 $C(=O)NH_2$, R^5 为氢原子;
- [0119] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^4 为 $C(=O)NH_2$, R^5 为卤素原子;
- [0120] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^4 为 $C(=O)NH_2$, R^5 为氟原子或氯原子;
- [0121] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^4 为 $C(=O)NH_2$, R^5 为甲基;
- [0122] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为三氟甲基, R^4 为氰基, R^5 为氢原子;
- [0123] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为三氟甲基, R^4 为氰基, R^5 为卤素原子;

[0124] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为三氟甲基, R^4 为氰基, R^5 为氟原子或氯原子;

[0125] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为三氟甲基, R^4 为氰基, R^5 为甲基;

[0126] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为三氟甲基, R^4 为 $C(=O)NH_2$, R^5 为氢原子;

[0127] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为三氟甲基, R^4 为 $C(=O)NH_2$, R^5 为卤素原子;

[0128] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为三氟甲基, R^4 为 $C(=O)NH_2$, R^5 为氟原子或氯原子;

[0129] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为三氟甲基, R^4 为 $C(=O)NH_2$, R^5 为甲基;

[0130] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为 1,1,2,2,2-五氟乙基, R^4 为氰基, R^5 为氢原子;

[0131] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为 1,1,2,2,2-五氟乙基, R^4 为氰基, R^5 为卤素原子;

[0132] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为 1,1,2,2,2-五氟乙基, R^4 为氰基, R^5 为氟原子或氯原子;

[0133] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为 1,1,2,2,2-五氟乙基, R^4 为氰基, R^5 为甲基;

[0134] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为 1,1,2,2,2-五氟乙基, R^4 为 $C(=O)NH_2$, R^5 为氢原子;

[0135] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为 1,1,2,2,2-五氟乙基, R^4 为 $C(=O)NH_2$, R^5 为卤素原子;

[0136] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为 1,1,2,2,2-五氟乙基, R^4 为 $C(=O)NH_2$, R^5 为氟原子或氯原子;

[0137] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为 1,1,2,2,2-五氟乙基, R^4 为 $C(=O)NH_2$, R^5 为甲基;

[0138] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基, R^4 为氰基, R^5 为氢原子;

[0139] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基, R^4 为氰基, R^5 为卤素原子;

[0140] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基, R^4 为氰基, R^5 为氟原子或氯原子;

[0141] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基, R^4 为氰基, R^5 为甲基;

[0142] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基, R^4 为 $C(=O)NH_2$, R^5 为氢原子;

[0143] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基

基, R^4 为 $C(=O)NH_2$, R^5 为卤素原子;

[0144] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基, R^4 为 $C(=O)NH_2$, R^5 为氟原子或氯原子;

[0145] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 n 为 2, m 为 2, R^1 为 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基, R^4 为 $C(=O)NH_2$, R^5 为甲基;

[0146] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^1 为三氟甲基、1,1,2,2,2-五氟乙基或 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基, R^2 为被至少一个卤素原子任选取代的 C1-C4 烷基, R^3 为氢原子、甲基、乙基、氟原子或氯原子, R^4 为氰基、 $C(=O)OR^7$ 或 $C(=O)N(R^8)_2$, R^5 为氢原子、甲基、乙基、氟原子或氯原子, R^6 为三氟甲基、1,1,2,2,2-五氟乙基或 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基, m 为 2, R^7 为甲基, 每个 R^8 独立地为氢原子或甲基;

[0147] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^1 为三氟甲基、1,1,2,2,2-五氟乙基或 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基, R^2 为被至少一个卤素原子任选取代的 C1-C4 烷氧基或被至少一个卤素原子任选取代的 C1-C4 烷硫基, R^3 为氢原子、甲基、乙基、氟原子或氯原子, R^4 为氰基、 $C(=O)OR^7$ 或 $C(=O)N(R^8)_2$, R^5 为氢原子、甲基、乙基、氟原子或氯原子, R^6 为三氟甲基、1,1,2,2,2-五氟乙基或 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基, m 为 2, R^7 为甲基, 每个 R^8 独立地为氢原子或甲基;

[0148] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^1 为三氟甲基, R^2 为甲基或乙基, R^3 为氢原子、甲基、乙基、氟原子或氯原子, R^4 为氰基、 $C(=O)OR^7$ 或 $C(=O)N(R^8)_2$, R^5 为氢原子、甲基、乙基、氟原子或氯原子, R^6 为三氟甲基、1,1,2,2,2-五氟乙基或 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基, m 为 2, R^7 为甲基, R^8 为氢原子;

[0149] 由式 (I) 表示的有机硫化合物, 其中 R^1 为三氟甲基, R^2 为甲氧基或甲硫基, R^3 为氢原子、甲基、乙基、氟原子或氯原子, R^4 为氰基、 $C(=O)OR^7$ 或 $C(=O)N(R^8)_2$, R^5 为氢原子、甲基、乙基、氟原子或氯原子, R^6 为三氟甲基、1,1,2,2,2-五氟乙基或 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基, m 为 2, R^7 为甲基, R^8 为氢原子。

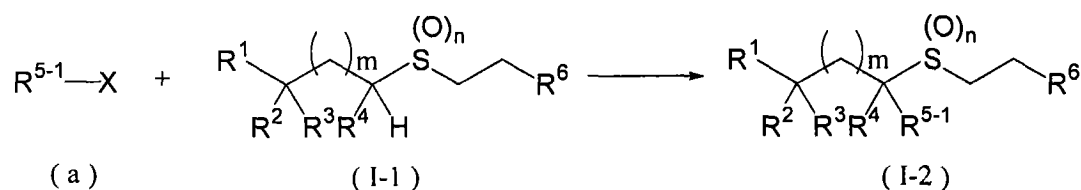
[0150] 接下来对本发明化合物的制备方法进行阐述。

[0151] 可以通过例如下述制备方法 1-12 来制备本发明的化合物。

[0152] 制备方法 1

[0153] 本发明的化合物中, 化合物 (I-2) 即其中 R^5 为 C1-C4 烷基的式 (I) 化合物, 可通过例如使化合物 (a) 与化合物 (I-1) 如下进行反应来制备:

[0154]



[0155] 其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^6 、 m 和 n 如上定义, R^{5-1} 表示 C1-C4 烷基, X 表示离去基团例如氯原子、溴原子、碘原子、甲磺酰氧基、对甲苯磺酰氧基或三氟甲磺酰氧基。

[0156] 该反应通常在碱存在下在溶剂中进行。

[0157] 该反应中所用溶剂的实例包括 N,N-二甲基甲酰胺等酰胺; 乙醚和四氢呋喃等醚; 二甲亚砜和环丁砜等有机硫; 氯仿、1,2-二氯乙烷和氯苯等卤代烃; 甲苯和二甲苯等芳香

烃；水；及其混合物。

[0158] 该反应中所用碱的实例包括氢化钠、氢氧化钠、氢氧化钾和碳酸钾等无机碱；甲醇钠和叔丁醇钾等碱金属醇盐；二异丙基氨基锂等碱金属氨基化物；以及三乙胺、1,4-二氮杂二环[2.2.2]辛烷和1,8-二氮杂二环[5.4.0]-7-十一碳烯等有机碱。

[0159] 该反应中所用碱的量相对于1mol化合物(I-1)通常为1-10mol。

[0160] 该反应中所用化合物(a)的量相对于1mol化合物(I-1)通常为1-10mol。

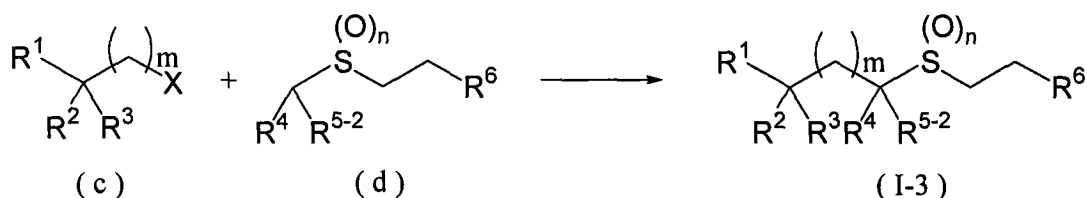
[0161] 该反应的温度范围通常为-100℃至100℃，反应时间通常为1-24小时。

[0162] 该反应完成后，化合物(I-2)可通过后处理进行分离，例如将反应混合物倒入水中，将所得混合物用有机溶剂萃取之后浓缩。必要时，分离的化合物(I-2)可用柱色谱法、重结晶法等进一步纯化。

[0163] 制备方法2

[0164] 本发明的化合物中，化合物(I-3)即其中R⁵为氢原子或C1-C4烷基的式(I)化合物，可通过例如使化合物(c)与化合物(d)如下进行反应来制备：

[0165]



[0166] 其中R¹、R²、R³、R⁴、R⁶、m、n和X如上定义，R⁵⁻²表示氢原子或C1-C4烷基。

[0167] 该反应通常在碱存在下在溶剂中进行。

[0168] 该反应中所用溶剂的实例包括N,N-二甲基甲酰胺等酰胺；乙醚和四氢呋喃等醚；二甲亚砜和环丁砜等有机硫；氯仿、1,2-二氯乙烷和氯苯等卤代烃；甲苯和二甲苯等芳香烃；水；及其混合物。

[0169] 该反应中所用碱的实例包括氢化钠、氢氧化钠、氢氧化钾和碳酸钾等无机碱；甲醇钠和叔丁醇钾等碱金属醇盐；二异丙基氨基锂等碱金属氨基化物；以及三乙胺、1,4-二氮杂二环[2.2.2]辛烷和1,8-二氮杂二环[5.4.0]-7-十一碳烯等有机碱。

[0170] 该反应中所用碱的量相对于1mol化合物(d)通常为1-10mol。

[0171] 该反应中所用化合物(c)的量相对于1mol化合物(d)通常为1-10mol。

[0172] 该反应的温度范围通常为-100℃至100℃，反应时间通常为1-24小时。

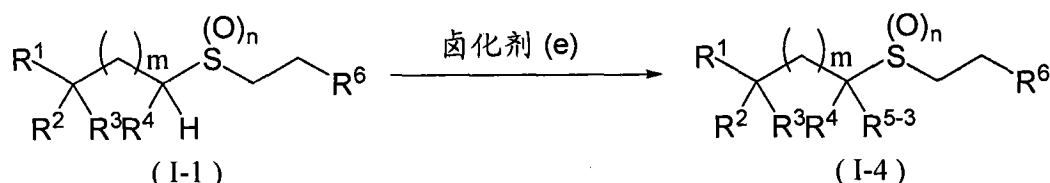
[0173] 该反应完成后，化合物(I-3)可通过后处理进行分离，例如将反应混合物倒入水中，将所得混合物用有机溶剂萃取之后浓缩。必要时，分离的化合物(I-3)可用柱色谱法、重结晶法等进一步纯化。

[0174] 本发明的化合物中，化合物(I-4)即其中R⁵为卤素原子的式(I)化合物，可通过例如根据下列制备方法3或4来制备。

[0175] 制备方法3

[0176] 该方法包括在碱存在下使化合物(I-1)与卤化剂(e)如下进行反应：

[0177]



[0178] 其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^6 、 m 和 n 如上定义， R^{5-3} 表示卤素原子。

[0179] 该反应通常在碱存在下在溶剂中进行。

[0180] 该反应中所用溶剂的实例包括 N,N -二甲基甲酰胺等酰胺；乙醚和四氢呋喃等醚；二甲亚砜和环丁砜等有机硫；氯仿、1,2-二氯乙烷和氯苯等卤代烃；甲苯和二甲苯等芳香烃；水；及其混合物。

[0181] 该反应中所用碱的实例包括氢化钠、氢氧化钠、氢氧化钾和碳酸钾等无机碱；甲醇钠和叔丁醇钾等碱金属醇盐；二异丙基氨基锂等碱金属氨基化物；以及三乙胺、1,4-二氮杂二环[2.2.2]辛烷和1,8-二氮杂二环[5.4.0]-7-十一碳烯等有机碱。

[0182] 该反应中所用碱的量相对于 1mol 化合物 (I-1) 通常为 1-10mol。

[0183] 该反应中所用卤化剂 (e) 的实例包括四氯化碳和六氯乙烷等卤代烃；氟、氯、溴和碘等卤素； N -氯代琥珀酰亚胺， N -溴代琥珀酰亚胺和 N -碘代琥珀酰亚胺等卤代琥珀酰亚胺；三氟甲磺酸 1-氟-2,4,6-三甲基吡啶鎓和双-四氟硼酸 1,1'-二氟-2,2'-联吡啶鎓等 N -氟吡啶鎓盐；以及氯化铜 (II) 和溴化铜 (II) 等无机盐。

[0184] 该反应中所用卤化剂 (e) 的量相对于 1mol 化合物 (I-1) 通常为 1-10mol。

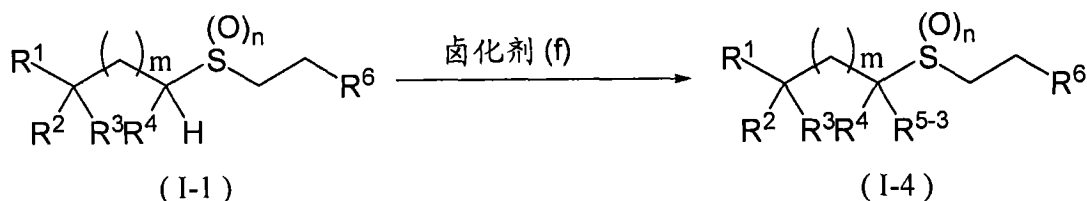
[0185] 该反应的温度范围通常为 -100°C 至 100°C ，反应时间通常为 1-24 小时。

[0186] 该反应完成后，化合物 (I-4) 可通过后处理进行分离，例如将反应混合物倒入水中，将所得混合物用有机溶剂萃取之后浓缩。必要时，分离的化合物 (I-4) 可用柱色谱法、重结晶法等进一步纯化。

[0187] 制备方法 4

[0188] 该方法包括使化合物 (I-1) 与卤化剂 (f) 如下进行反应：

[0189]



[0190] 其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^{5-3} 、 R^6 、 m 和 n 如上定义。

[0191] 该反应通常无需任何溶剂，或者在溶剂中进行。

[0192] 该反应中所用溶剂的实例包括氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷和氯苯等卤代烃；甲苯和二甲苯等芳香烃；乙腈和丙腈等脂肪族腈；乙酸、二硫化碳等脂肪族羧酸；水；及其混合物。

[0193] 该反应中所用卤化剂 (f) 的实例包括氟、氯、溴和碘等卤素；氟化氢、氯化氢、溴化氢和碘化氢等卤化氢；亚硫酰氯、亚硫酰溴和磺酰溴等卤化硫化合物 (halogenated sulfur compound)；三氯化磷、三溴化磷、五氯化磷和三氯化磷等卤化磷化合物。

[0194] 该反应中所用卤化剂 (f) 的量相对于 1mol 化合物 (I-1) 通常为 1-10mol。

[0195] 该反应的温度范围通常为 -100°C 至 200°C ，反应时间通常为 1-24 小时。

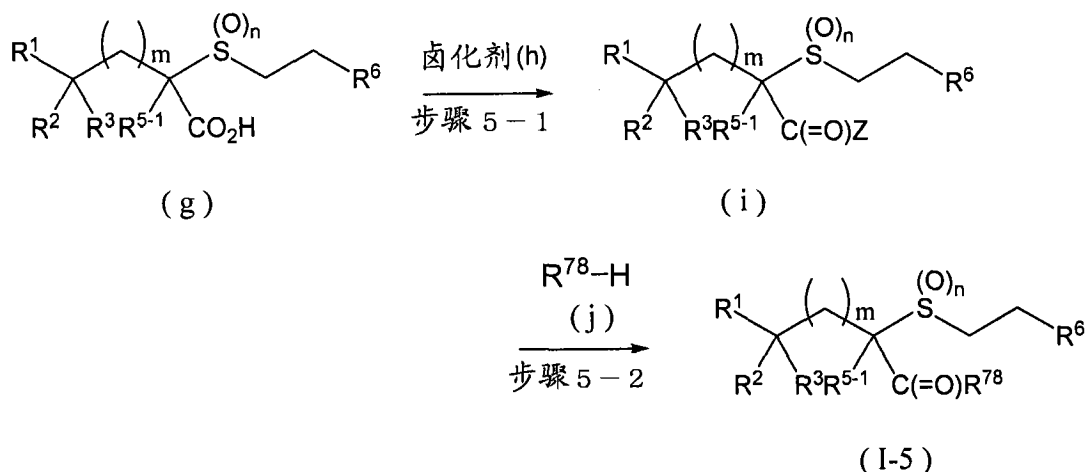
[0196] 该反应完成后,化合物(I-4)可通过后处理进行分离,例如将反应混合物倒入水中,将所得混合物用有机溶剂萃取之后浓缩。必要时,分离的化合物(I-4)可用柱色谱法、重结晶法等进行进一步纯化。

[0197] 本发明的化合物中,化合物(I-5)即其中 R^4 为 $C(=O)OR^7$ 或 $C(=O)N(R^8)_2$ 的式(I)化合物,可通过例如下列制备方法5或6来制备。

[0198] 制备方法5

[0199] 该方法包括使化合物(i)与化合物(j)如下进行反应:

[0200]



[0201] 其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^{5-1} 、 R^6 、 m 和 n 如上定义, Z 表示卤素原子, R^{78} 表示 OR^7 或 $N(R^8)_2$,其中 R^7 和 R^8 如上定义。

[0202] 步骤5-1:

[0203] 化合物(i)可通过使化合物(g)与卤化剂(h)反应制备。

[0204] 该反应可无需溶剂,或者在溶剂中进行。

[0205] 该反应中所用溶剂的实例包括氯仿、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷和氯苯等卤代烃;甲苯和二甲苯等芳香烃。

[0206] 该反应中所用卤化剂(h)的实例包括草酰氯、亚硫酰氯、亚硫酰溴、三氯化磷、三溴化磷和五氯化磷。

[0207] 该反应中所用卤化剂(h)的量相对于1mol化合物(g)通常为1mol至足以作为溶剂的量。

[0208] 该反应的温度范围通常为 -20°C 至 100°C ,反应时间通常为1-24小时。

[0209] 该反应完成后,化合物(i)可通过浓缩反应混合物等处理来进行分离。分离的化合物(i)可通过蒸馏等进行进一步纯化。

[0210] 步骤5-2:

[0211] 该反应通常在碱存在下在溶剂中进行。

[0212] 该反应中所用溶剂的实例包括N,N-二甲基甲酰胺等酰胺;乙醚和四氢呋喃等醚;二甲亚砜和环丁砜等有机硫;氯仿、1,2-二氯乙烷和氯苯等卤代烃;甲苯和二甲苯等芳香烃;水;及其混合物。

[0213] 该反应中所用碱的实例包括氢化钠、氢氧化钠、氢氧化钾和碳酸钾等无机碱;以及三乙胺、1,4-二氮杂二环[2.2.2]辛烷和1,8-二氮杂二环[5.4.0]-7-十一碳烯等有机碱。

[0214] 该反应中所用碱的量相对于 1mol 化合物 (i) 通常为 1-10mol。

[0215] 该反应中所用化合物 (j) 的量相对于 1mol 化合物 (i) 通常为 1-10mol。

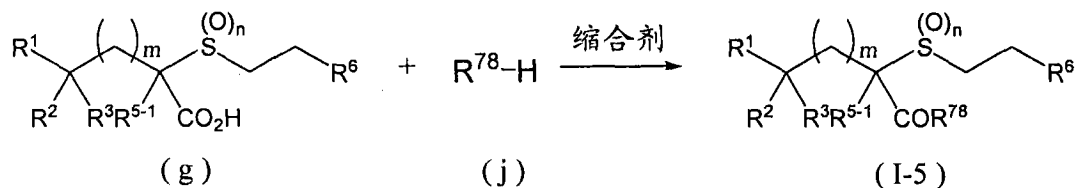
[0216] 该反应的温度范围通常为 -20℃至 100℃,反应时间通常为 1-24 小时。

[0217] 该反应完成后,化合物(I-5)可通过后处理进行分离,例如将反应混合物倒入水中,将所得混合物用有机溶剂萃取之后浓缩。必要时,分离的化合物(I-5)可用柱色谱法、重结晶法等进一步纯化。

[0218] 制备方法 6

[0219] 该方法包括使化合物 (g) 与化合物 (j) 如下进行反应:

[0220]



[0221] 其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^{5-1} 、 R^6 、 m 和 n 如上定义, R^{78} 表示 OR^7 或 $N(R^8)_2$, 其中 R^7 和 R^8 如上定义。

[0222] 该反应通常在缩合剂存在下在溶剂中进行。

[0223] 该反应中所用溶剂的实例包括乙醚和四氢呋喃等醚；二甲亚砜和环丁砜等有机硫；氯仿、1,2-二氯乙烷和氯苯等卤代烃；以及甲苯和二甲苯等芳香烃。

[0224] 该反应中所用缩合剂的实例包括二环己基碳二亚胺、N-(3-二甲基氨基丙基)-N'-乙基碳二亚胺和羰基二咪唑。

[0225] 该反应中所用缩合剂的量相对于 1mol 化合物 (g) 通常为 1-10mol。

[0226] 该反应中所用化合物 (j) 的量相对于 1mol 化合物 (g) 通常为 1-10mol。

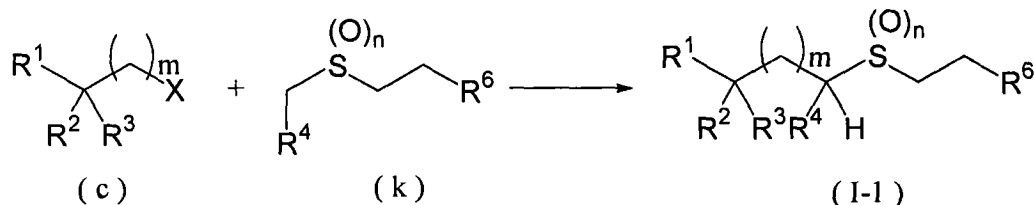
[0227] 该反应的温度范围通常为 -20℃至 100℃,反应时间通常为 1-24 小时。

[0228] 该反应完成后,化合物(I-5)可通过浓缩等处理来进行分离。必要时,分离的化合物(I-5)可用柱色谱法、重结晶法等进一步纯化。

[0229] 制备方法 7

[0230] 本发明的化合物中,化合物(I-1)即其中 R^5 为氢原子的式(I)化合物,可通过例如使化合物(c)与化合物(k)如下进行反应来制备:

[0231]



[0232] 其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^6 、X、m 和 n 如上定义。

[0233] 该反应通常在碱存在下在溶剂中进行。

[0234] 该反应中所用溶剂的实例包括 N,N-二甲基甲酰胺等酰胺;乙醚和四氢呋喃等醚;二甲亚砜和环丁砜等有机硫;氯仿、1,2-二氯乙烷和氯苯等卤代烃;甲苯和二甲苯等芳香烃;水;及其混合物。

[0235] 该反应中所用碱的实例包括氢化钠、氢氧化钠、氢氧化钾和碳酸钾等无机碱；甲

醇钠和叔丁醇钾等碱金属醇盐；二异丙基氨基锂等碱金属氨基化物；以及三乙胺、1,4-二氮杂二环 [2.2.2] 辛烷和 1,8-二氮杂二环 [5.4.0]-7-十一碳烯等有机碱。

[0236] 该反应中所用碱的量相对于 1mol 化合物 (k) 通常为 1-10mol。

[0237] 该反应中所用化合物 (c) 的量相对于 1mol 化合物 (k) 通常为 1-10mol。

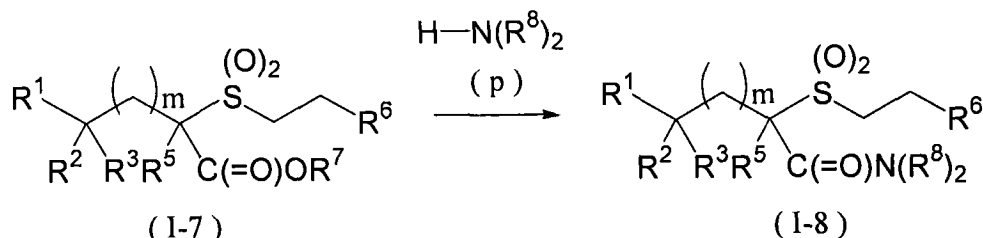
[0238] 该反应的温度范围通常为 -100℃ 至 100℃，反应时间通常为 1-24 小时。

[0239] 该反应完成后，化合物 (I-1) 可通过后处理进行分离，例如将反应混合物倒入水中，将所得混合物用有机溶剂萃取之后浓缩。必要时，分离的化合物 (I-1) 可用柱色谱法、重结晶法等进一步纯化。

[0240] 制备方法 8

[0241] 本发明的化合物中，化合物 (I-8) 即其中 R^4 为 $C(=O)N(R^8)_2$ 、 n 为 2 的式 (I) 化合物，可通过使化合物 (I-7) 即其中 R^4 为 $C(=O)OR^7$ 、 n 为 2 的式 (I) 化合物与化合物 (p) 如下进行反应来制备：

[0242]



[0243] 其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 m 和 n 如上定义。

[0244] 该反应通常在溶剂中进行。

[0245] 该反应中所用溶剂的实例包括乙醚和四氢呋喃等醚；二甲亚砜和环丁砜等有机硫；氯仿、1,2-二氯乙烷和氯苯等卤代烃；以及甲苯和二甲苯等芳香烃。

[0246] 该反应中所用化合物 (p) 的量相对于 1mol 化合物 (I-7) 通常为 1-10mol。

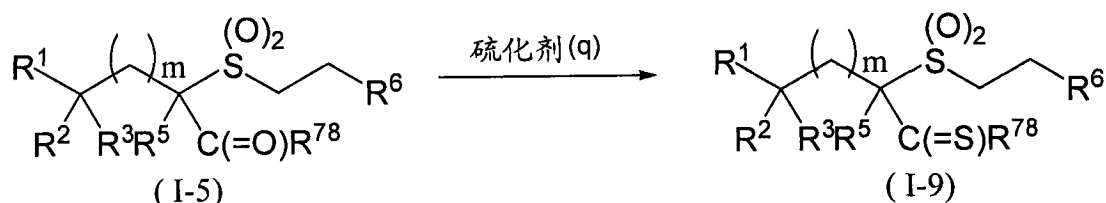
[0247] 该反应的温度范围通常为 -20℃ 至 100℃，反应时间通常为 1-24 小时。

[0248] 该反应完成后，化合物 (I-8) 可通过浓缩等处理来进行分离。必要时，分离的化合物 (I-8) 可用柱色谱法、重结晶法等进一步纯化。

[0249] 制备方法 9

[0250] 本发明的化合物中，化合物 (I-9) 即其中 R^4 为 $C(=S)OR^7$ 或 $C(=S)N(R^8)_2$ 的式 (I) 化合物，还可通过使化合物 (I-5) 即其中 R^4 为 $C(=O)OR^7$ 或 $C(=O)N(R^8)_2$ 的式 (I) 化合物与硫化剂 (q) 如下进行反应来制备：

[0251]



[0252] 其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^{78} 、 m 和 n 如上定义。

[0253] 该反应通常在溶剂中进行。

[0254] 该反应中所用溶剂的实例包括氯仿、1,2-二氯乙烷和氯苯等卤代烃；以及甲苯和二甲苯等芳香烃。

[0255] 该反应中所用硫化剂 (q) 的实例包括硫化氢、五硫化二磷等无机硫化合物以及 2, 4- 双 (4- 甲氧基苯基) -1, 3- 二硫杂 -2, 4- 二磷杂环丁烷 -2, 4- 二硫化物等有机硫化合物。

[0256] 该反应中所用硫化剂 (q) 的量相对于 1mol 化合物 (I-5) 通常为 0.5-10mol。

[0257] 该反应的温度范围通常为 0-250℃, 反应时间通常为 1-72 小时。

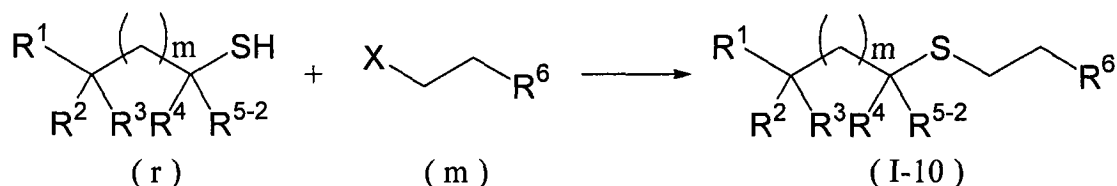
[0258] 该反应完成后, 化合物 (I-9) 可通过浓缩等处理来进行分离。必要时, 分离的化合物 (I-9) 可用柱色谱法、重结晶法等进一步纯化。

[0259] 本发明的化合物中, 化合物 (I-10) 即其中 n 为 0 的式 (I) 化合物可通过例如下列制备方法 10 或 11 来制备。

[0260] 制备方法 10

[0261] 该方法包括使化合物 (r) 与化合物 (m) 如下进行反应:

[0262]



[0263] 其中 R¹、R²、R³、R⁴、R⁵⁻²、R⁶、m 和 X 如上定义。

[0264] 该反应通常在碱存在下在溶剂中进行。

[0265] 该反应中所用溶剂的实例包括 N, N- 二甲基甲酰胺等酰胺; 乙醚和四氢呋喃等醚; 二甲亚砜和环丁砜等有机硫; 氯仿、1, 2- 二氯乙烷和氯苯等卤代烃; 甲苯和二甲苯等芳香烃; 水; 及其混合物。

[0266] 该反应中所用碱的实例包括氢化钠、氢氧化钠、氢氧化钾和碳酸钾等无机碱; 甲醇钠和叔丁醇钾等碱金属醇盐; 二异丙基氨基锂等碱金属氨基化物; 以及三乙胺、1, 4- 二氮杂二环 [2. 2. 2] 辛烷和 1, 8- 二氮杂二环 [5. 4. 0] -7- 十一碳烯等有机碱。

[0267] 该反应中所用碱的量相对于 1mol 化合物 (r) 通常为 1-10mol。

[0268] 该反应中所用化合物 (m) 的量相对于 1mol 化合物 (r) 通常为 1-10mol。

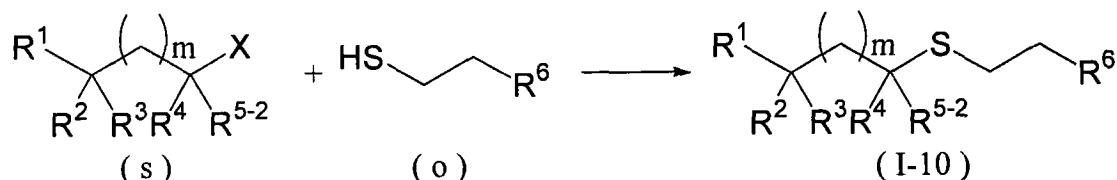
[0269] 该反应的温度范围通常为 -20℃ 至 100℃, 反应时间通常为 1-24 小时。

[0270] 该反应完成后, 化合物 (I-10) 可通过后处理进行分离, 例如将反应混合物倒入水中, 将所得混合物用有机溶剂萃取之后浓缩。必要时, 分离的化合物 (I-10) 可用柱色谱法、重结晶法等进一步纯化。

[0271] 制备方法 11

[0272] 该方法包括使化合物 (s) 与化合物 (o) 如下进行反应:

[0273]



[0274] 其中 R¹、R²、R³、R⁴、R⁵⁻²、R⁶、m 和 X 如上定义。

[0275] 该反应通常在碱存在下在溶剂中进行。

[0276] 该反应中所用溶剂的实例包括 N, N- 二甲基甲酰胺等酰胺; 乙醚和 四氢呋喃等

醚；二甲亚砜和环丁砜等有机硫；氯仿、1,2-二氯乙烷和氯苯等卤代烃；甲苯和二甲苯等芳香烃；水；及其混合物。

[0277] 该反应中所用碱的实例包括氢化钠、氢氧化钠、氢氧化钾和碳酸钾等无机碱；甲醇钠和叔丁醇钾等碱金属醇盐；二异丙基氨基锂等碱金属氨基化物；以及三乙胺、1,4-二氮杂二环[2.2.2]辛烷和1,8-二氮杂二环[5.4.0]-7-十一碳烯等有机碱。

[0278] 该反应中所用碱的量相对于1mol化合物(o)通常为1-10mol。

[0279] 该反应中所用化合物(s)的量相对于1mol化合物(o)通常为1-10mol。

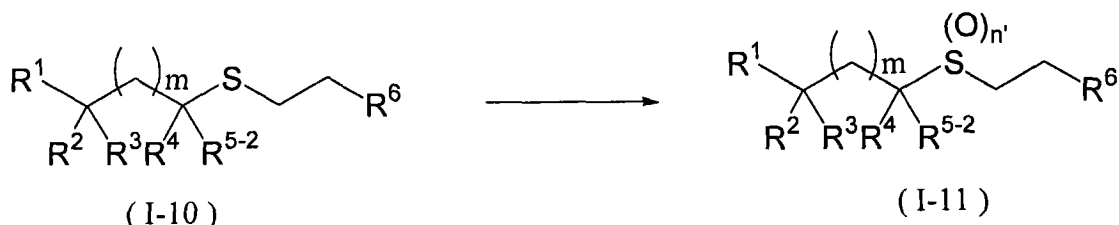
[0280] 该反应的温度范围通常为-20℃至100℃，反应时间通常为1-24小时。

[0281] 该反应完成后，化合物(I-10)可通过后处理进行分离，例如将反应混合物倒入水中，将所得混合物用有机溶剂萃取之后浓缩。必要时，分离的化合物(I-10)可用柱色谱法、重结晶法等进行进一步纯化。

[0282] 制备方法12

[0283] 本发明的化合物中，化合物(I-11)即其中n为1或2的式(I)化合物，可通过例如使化合物(I-10)如下进行氧化来制备：

[0284]



[0285] 其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^{5-2} 、 R^6 和m如上定义， n' 表示1或2。

[0286] 该反应通常在氧化剂存在下在溶剂中进行。

[0287] 该反应中所用溶剂的实例包括甲醇和乙醇等醇；二氯甲烷和氯仿等卤代烃；甲苯和二甲苯等芳香烃；乙酸和三氟乙酸等脂肪族羧酸；水；及其混合物。

[0288] 该反应中所用氧化剂的实例包括过乙酸、三氟过乙酸和间氯过苯甲酸等有机过氧化物；氯和溴等卤素分子；N-氯代琥珀酰亚胺等含卤素的酰亚胺；高氯酸（或其盐）和高碘酸（或其盐）等卤化物；高锰酸钾等高锰酸盐；铬酸钾等铬酸盐；和过氧化氢。

[0289] 该反应中所用氧化剂的量相对于1mol化合物(I-10)通常为1-10mol。

[0290] 该反应的温度范围通常为-50℃至200℃，反应时间通常为1-72小时。

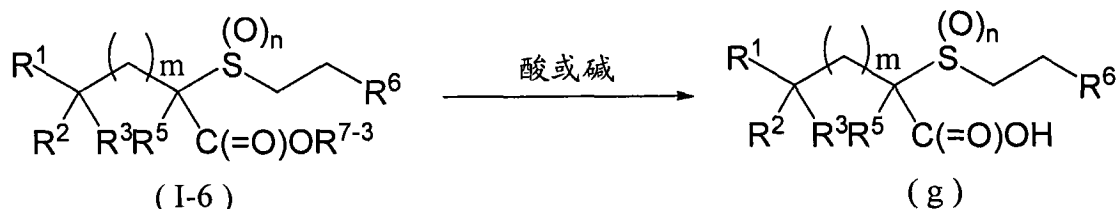
[0291] 该反应完成后，化合物(I-11)可通过后处理进行分离，例如将反应混合物倒入水中，将所得混合物用有机溶剂萃取之后浓缩。必要时，分离的化合物(I-11)可用柱色谱法、重结晶法等进行进一步纯化。

[0292] 接下来，对用于制备本发明化合物的中间体的制备方法通过参考制备方法予以阐述。

[0293] 参考制备方法1

[0294] 可通过下列方法使化合物(I-6)水解来制备化合物(g)：

[0295]



[0296] 其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 m 和 n 如上定义， R^{7-3} 为甲基或乙基。

[0297] 该反应通常在酸或碱以及水存在下在有机溶剂中进行。

[0298] 该反应中所用有机溶剂的实例包括甲醇和乙醇等醇；乙醚和四氢呋喃等醚；二甲亚砜和环丁砜等有机硫；氯仿、1,2-二氯乙烷和氯苯等卤代烃；甲苯和二甲苯等芳香烃；甲酸和乙酸等脂肪族羧酸；及其混合物。

[0299] 该反应中所用碱的实例包括氢氧化钠和氢氧化钾等无机碱。

[0300] 该反应中所用酸的实例包括盐酸和硫酸等无机酸。

[0301] 该反应中所用酸或碱的量相对于 1mol 化合物 (I-6) 通常为 1-10mol。

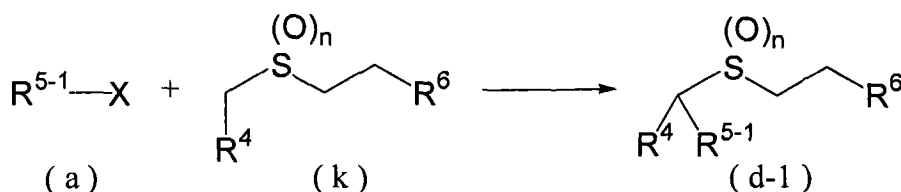
[0302] 该反应的温度范围通常为 -20°C 至 100°C ，反应时间通常为 1-24 小时。

[0303] 必要时，在该反应完成后，化合物 (g) 可通过后处理进行分离，例如将水和 / 或酸加到反应混合物中，将所得混合物用有机溶剂萃取之后浓缩。必要时，分离的化合物 (g) 可用柱色谱法、重结晶法等进一步纯化。

[0304] 参考制备方法 2

[0305] 化合物 (d) 中，化合物 (d-1) 即其中 R^5 为 C1-C4 烷基的化合物 (d) 可通过例如使化合物 (a) 与化合物 (k) 如下进行反应来制备：

[0306]



[0307] 其中 R^4 、 R^{5-1} 、 R^6 、 n 和 X 如上定义。

[0308] 该反应通常在碱存在下在溶剂中进行。

[0309] 该反应中所用溶剂的实例包括 N,N-二甲基甲酰胺等酰胺；乙醚和四氢呋喃等醚；二甲亚砜和环丁砜等有机硫；氯仿、1,2-二氯乙烷和氯苯等卤代烃；甲苯和二甲苯等芳香烃；水；及其混合物。

[0310] 该反应中所用碱的实例包括氢化钠、氢氧化钠、氢氧化钾和碳酸钾等无机碱；甲醇钠和叔丁醇钾等碱金属醇盐；二异丙基氨基锂等碱金属氨基化物；以及三乙胺、1,4-二氮杂二环 [2.2.2] 辛烷和 1,8-二氮杂二环 [5.4.0]-7-十一碳烯等有机碱。

[0311] 该反应中所用碱的量相对于 1mol 化合物 (k) 通常为 1-10mol。

[0312] 该反应中所用化合物 (a) 的量相对于 1mol 化合物 (k) 通常为 1-10mol。

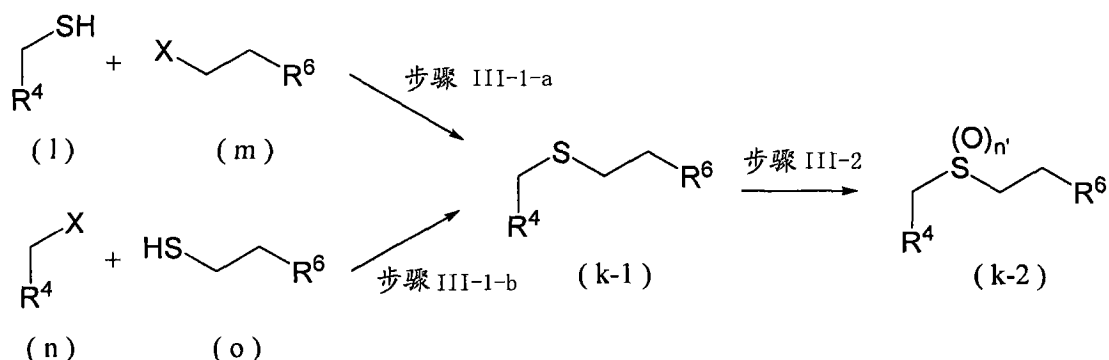
[0313] 该反应的温度范围通常为 -20°C 至 100°C ，反应时间通常为 1-24 小时。

[0314] 该反应完成后，化合物 (d-1) 可通过后处理进行分离，例如将反应混合物倒入水中，将所得混合物用有机溶剂萃取之后浓缩。必要时，分离的化合物 (d-1) 可用柱色谱法、重结晶法等进一步纯化。

[0315] 参考制备方法 3

[0316] 化合物 (k) 中, 化合物 (k-1) 即其中 n 为 0 的化合物 (k) 和化合物 (k-2) 即其中 n 为 1 或 2 的化合物 (k), 可通过下列流程来制备:

[0317]



[0318] 其中 R^4 、 R^6 、X 和 n' 如上定义。

[0319] 步骤 III-1-a:

[0320] 化合物 (k-1) 可通过例如使化合物 (1) 与化合物 (m) 反应来制备。

[0321] 该反应通常在碱存在下在溶剂中进行。

[0322] 该反应中所用溶剂的实例包括 N, N-二甲基甲酰胺等酰胺; 乙醚和四氢呋喃等醚; 二甲亚砜和环丁砜等有机硫; 氯仿、1, 2-二氯乙烷和氯苯等卤代烃; 甲苯和二甲苯等芳香烃; 水; 及其混合物。

[0323] 该反应中所用碱的实例包括氢化钠、氢氧化钠、氢氧化钾和碳酸钾等无机碱; 甲醇钠和叔丁醇钾等碱金属醇盐; 二异丙基氨基锂等碱金属氨基化物; 以及三乙胺、1, 4-二氮杂二环 [2. 2. 2] 辛烷和 1, 8-二氮杂二环 [5. 4. 0]-7-十一碳烯等有机碱。

[0324] 该反应中所用碱的量相对于 1mol 化合物 (1) 通常为 1-10mol。

[0325] 该反应中所用化合物 (m) 的量相对于 1mol 化合物 (1) 通常为 1-10mol。

[0326] 该反应的温度范围通常为 -20°C 至 100°C , 反应时间通常为 1-24 小时。

[0327] 该反应完成后, 化合物 (k-1) 可通过后处理进行分离, 例如将反应混合物倒入水中, 将所得混合物用有机溶剂萃取之后浓缩。必要时, 分离的化合物 (k-1) 可用柱色谱法、重结晶法等进一步纯化。

[0328] 步骤 III-1-b:

[0329] 化合物 (k-1) 还可通过例如使化合物 (n) 与化合物 (o) 反应来制备。

[0330] 该反应通常在碱存在下在溶剂中进行。

[0331] 该反应中所用溶剂的实例包括 N, N-二甲基甲酰胺等酰胺; 乙醚和四氢呋喃等醚; 二甲亚砜和环丁砜等有机硫; 氯仿、1, 2-二氯乙烷和氯苯等卤代烃; 甲苯和二甲苯等芳香烃; 水; 及其混合物。

[0332] 该反应中所用碱的实例包括氢化钠、氢氧化钠、氢氧化钾和碳酸钾等无机碱; 甲醇钠和叔丁醇钾等碱金属醇盐; 二异丙基氨基锂等碱金属氨基化物; 以及三乙胺、1, 4-二氮杂二环 [2. 2. 2] 辛烷和 1, 8-二氮杂二环 [5. 4. 0]-7-十一碳烯等有机碱。

[0333] 该反应中所用碱的量相对于 1mol 化合物 (o) 通常为 1-10mol。

[0334] 该反应中所用化合物 (n) 的量相对于 1mol 化合物 (o) 通常为 1-10mol。

[0335] 该反应的温度范围通常为 -20°C 至 100°C , 反应时间通常为 1-24 小时。

[0336] 该反应完成后,化合物(k-1)可通过后处理进行分离,例如将反应混合物倒入水中,将所得混合物用有机溶剂萃取之后浓缩。必要时,分离的化合物(k-1)可用柱色谱法、重结晶法等进行进一步纯化。

[0337] 步骤 III-2:

[0338] 化合物(k-2)可通过例如使化合物(k-1)氧化来制备。

[0339] 该反应通常在氧化剂存在下在溶剂中进行。

[0340] 该反应中所用溶剂的实例包括甲醇和乙醇等醇;二氯甲烷和氯仿等卤代烃;甲苯和二甲苯等芳香烃;乙酸和三氟乙酸等脂肪族羧酸;水;及其混合物。

[0341] 该反应中所用氧化剂的实例包括过乙酸、三氟过乙酸和间氯过苯甲酸等有机过氧化物;氯和溴等卤素分子;N-氯代琥珀酰亚胺等含卤素的酰亚胺;高氯酸(或其盐)和高碘酸(或其盐)等卤化物;高锰酸钾等高锰酸盐;铬酸钾等铬酸盐;和过氧化氢。

[0342] 该反应中所用氧化剂的量相对于 1mol 化合物(k-1)通常为 1-10mol。

[0343] 该反应的温度范围通常为 -50℃至 200℃,反应时间通常为 1-72 小时。

[0344] 该反应完成后,化合物(k-2)可通过后处理进行分离,例如将反应混合物倒入水中,将所得混合物用有机溶剂萃取之后浓缩。必要时,分离的化合物(k-2)可用柱色谱法、重结晶法等进行进一步纯化。

[0345] 上述化合物(o)和化合物(r)可分别按例如以下文献所述方法制备:Journal of Organic Chemistry,27(1),第 93-95 页(1962)和 HETEROCYCLES,24(5),第 1331-1346 页(1986)。

[0346] 上述化合物(s)可按照例如下述文献方法制备:The Journal of Organic Chemistry,18,第 1112-1161 页(1953)。

[0347] 上述化合物(a)、(c)、(j)、(m)、(n)和(p)是已知的,或者可按照已知方法制备。

[0348] 本发明的化合物对之具有防治效果的有害节肢动物的实例包括有害昆虫和有害螨虫,更准确地讲为下列节肢动物。

[0349] 半翅目(Hemiptera):

[0350] 飞虱(飞虱科(Delphacidae)),例如灰飞虱(*Laodelphax striatellus*)、褐稻虱(*Nilaparvata lugens*)和白背飞虱(*Sogatella furcifera*);叶蝉(leafhopper)(角顶叶蝉科(Deltocephalidae)),例如黑尾叶蝉(*Nephotettix cincticeps*)、二点黑尾叶蝉(*Nephotettix virescens*)和茶小绿叶蝉(*Empoasca onukii*);蚜虫(蚜科(Aphididae)),例如棉蚜(*Aphis gossypii*)、桃蚜(*Myzus persicae*)、甘蓝蚜(*Brevicoryne brassicae*)、绣线菊蚜(*Aphis spiraeicola*)、马铃薯长管蚜(*Macrosiphum euphorbiae*)、指顶花无网长管蚜(*Aulacorthum solani*)、禾谷缢管蚜(*Rhopalosiphum padi*)、桔蚜(*Toxoptera citricidus*)和梅大尾蚜(*Hyalopterus pruni*);蝽象(蝽科(Pentatomidae)),例如花角绿蝽(*Nezara antennata*)、豆蝽(*Riptortus clavatus*)、中华稻缘蝽(*Leptocoris chinensis*)、尖角二星蝽(*Eysarcoris parvus*)和蝽象(混茶翅蝽(*Halyomorpha mista*));粉虱(粉虱科(Aleyrodidae)),例如温室粉虱(*Trialeurodes vaporariorum*)、烟粉虱(*Bemisia tabaci*)、柑桔粉虱(*Dialeurodes citri*)和桔刺粉虱(*Aleurocanthus spiniferus*);蚧(scale)(蚧科(Coccidae)),例如红肾圆盾蚧(*Aonidiella aurantii*)、梨圆盾蚧(*Comstockaspis perniciosus*)、柑桔尖盾

蚧 (*Unaspiscitri*)、红蜡蚧 (*Ceroplastes rubens*)、吹棉蚧 (*Icerya purchasi*)、日本粉蚧 (*Planococcus kraunhiae*)、桑粉蚧 (*Cosmstock mealybug*) (长尾粉蚧 (*Pseudococcus longispinis*)) 和桑白盾蚧 (*Pseudaulacaspis pentagona*) ;网蝽 (网蝽科 (*Tingidae*)) ;臭虫,例如温带臭虫 (*Cimex lectularius*) ;木虱 (木虱科 (*Psyllidae*)) 等;

[0351] 鳞翅目 (*Lepidoptera*) :

[0352] 螟蛾 (螟蛾科 (*Pyralidae*)), 例如二化螟 (*Chilo suppressalis*)、三化螟 (*Tryporyza incertulas*)、稻纵卷叶螟 (*Cnaphalocrocis medinalis*)、棉大卷叶螟 (*Notarcha derogata*)、印度谷螟 (*Plodia interpunctella*)、豆荚野螟 (*Maruca testulalis*)、菜螟 (*Hellula undalis*) 和早熟禾草螟 (*Pediasiateterrellus*) ;梟蛾 (夜蛾科 (*Noctuidae*)), 例如斜纹夜蛾 (*Spodopteralitura*)、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua*)、粘虫 (*Pseudaletia separata*)、甘蓝夜蛾 (*Mamestra brassicae*)、小地老虎 (*Agrotis ipsilon*)、黑点弧翅夜蛾 (*Plusia nigrisigna*)、粉纹夜蛾 (*Thoricoplusia* spp.)、实夜蛾 (*Heliothis*spp.) 和铃夜蛾 (*Helicoverpa* spp.) ;白粉蝶 (粉蝶科 (*Pieridae*)), 例如菜粉蝶 (*Pieris rapae*) ;卷叶蛾 (卷蛾科 (*Tortricidae*)), 例如褐带卷蛾 (*Adoxophyes* spp.)、梨小食心虫 (*Grapholita molesta*)、大豆食心虫 (*Leguminivora glycinivorella*)、日豆食心虫 (*Matsumuraeses azukivora*)、夏果卷叶蛾 (summer fruit tortrix) (*Adoxophyes orana fasciata*)、茶小卷蛾 (smaller tea tortrix) (*Adoxophyes* sp.)、茶长卷蛾 (oriental tea tortrix) (*Homona magnanima*)、苹果卷蛾 (apple tortrix) (*Archips fuscocupreanus*) 和苹果蠹蛾 (*Cydia pomonella*) ;潜叶细蛾 (细蛾科 (*Gracillariidae*)), 例如茶叶细蛾 (*Caloptilia theivora*) 和窄翅潜蛾 (金纹小潜细蛾 (*Phyllonorycter ringoneella*)) ;蛀果蛾科 (*Carposinidae*), 例如桃蛀果蛾 (*Carposina niponensis*) ;潜蛾 (潜蛾科 (*Lyonetiidae*)), 例如潜叶蛾 (*Lyonetia* spp.) ;毒蛾 (毒蛾科 (*Lymantriidae*)), 例如毒蛾 (*Lymantria* spp.) 和黄毒蛾 (*Euproctis* spp.) ;巢蛾 (巢蛾科 (*Yponomeutidae*)), 例如小菜蛾 (*Plutella xylostella*) ;麦蛾 (麦蛾科 (*Gelechiidae*)), 例如棉红铃虫 (*Pectinophora gossypiella*) 和马铃薯块茎蛾 (*Phthorimaea operculella*) ;虎蛾及同类 (灯蛾科 (*Arctiidae*)), 例如美洲白蛾 (*Hyphantria cunea*) ;谷蛾 (谷蛾科 (*Tineidae*)), 例如网衣蛾 (*Tinea translucens*) 和幕衣蛾 (*Tineolabisselliella*) 等;

[0353] 缨翅目 (*Thysanoptera*) :

[0354] 柑桔蓟马 (*Yellow citrus thrip*) (西花蓟马 (*Frankliniella occidentalis*))、瓜蓟马 (*melon thrip*) (棕榈蓟马 (*Thrips palmi*))、茶黄硬蓟马 (*Scirtothrips dorsalis*)、烟蓟马 (*Thrips tabaci*)、丽花蓟马 (*Frankliniella intonsa*) 等;

[0355] 双翅目 (*Diptera*) :

[0356] 蚊 (蚊科 (*Calicidae*)), 例如普通蚊 (淡色库蚊 (*Culex pipiens pallens*))、三带喙库蚊 (*Culex tritaeniorhynchus*) 和南方家蚊 (*Culex quinquefasciatus*) ;伊蚊 (*Aedes* spp.), 例如黄热病蚊 (埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*)) 和亚洲虎蚊 (白纹伊蚊 (*Aedes albopictus*)) ;按蚊 (*Anopheles*spp.), 例如中华按蚊 (*Anopheles sinensis*) ;摇蚊科 (*Chironomidae*) ;家蝇 (蝇科 (*Muscidae*)), 例如家蝇 (*Musca domestica*) 和厩腐蝇 (*Muscinastabulans*) ;丽蝇 (丽蝇科 (*Calliphoridae*)) ;麻蝇 (麻蝇科 (*Sarcophagidae*)) ;

黄腹厩蝇 (厩蝇科 (Fanniidae)); 花蝇 (花蝇科 (Anthomyiidae)), 例如玉米种蝇 (灰地种蝇 (*Delia platura*)) 和葱地种蝇 (*Delia antiqua*); 潜蝇 (leafminer flies) (潜蝇科 (Agromyzidae)), 例如稻潜蝇 (*Agromyza oryzae*)、大麦毛眼水蝇 (*Hydrellia griseola*)、番茄斑潜蝇 (tomatoleafminer) (蔬菜斑潜蝇 (*Liriomyza sativae*))、豆潜蝇 (legume leafminer) (三叶草斑潜蝇 (*Liriomyza trifolii*)) 和豌豆潜叶蝇 (garden pea leafminer) (豌豆彩潜蝇 (*Chromatomyia horticola*)); 大麦黄潜蝇 (黄潜蝇科 (Chloropidae)), 例如稻黄潜蝇 (*Chlorops oryzae*); 果蝇 (实蝇科 (Tephritidae)), 例如瓜寡鬃实蝇 (*Dacus cucurbitae*) 和地中海实蝇 (*Ceratitis capitata*); 果蝇 (果蝇科 (Drosophilidae)); 驼背蝇 (蚤蝇科 (Phoridae)), 例如东亚异蚤蝇 (*Megaselia spiracularis*); 毛蠓科 (Psychodidae), 例如毛蠓 (*Clogmia albipunctata*); 蚋科 (Simuliidae); 虻科 (Tabanidae), 例如马虻 (三膝虻 (*Tabanus trigonus*)); 厩螫蝇 (*Stomoxys calcitrans*) 等;

[0357] 鞘翅目 (Coleoptera):

[0358] 玉米根叶甲 (Corn root worm) (*Diabrotica* spp.), 例如西方玉米根叶甲 (*Diabrotica virgifera virgifera*) 和南方玉米根叶甲 (*Diabrotica undecimpunctata howardi*); 金龟子 (金龟子科 (Scarabaeidae)), 例如古铜异丽金龟 (*Anomala cuprea*)、大豆甲虫 (soybean beetle) (多色丽金龟 (*Anomala rufocuprea*)) 和日本弧丽金龟 (*Popillia japonica*); 象甲 (象甲科 (Curculionidae)), 例如玉米象 (*Sitophilus zeamais*)、稻水象 (rice waterweevil) (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、绿豆象 (azuki bean weevil) (*Callosobruchus chinensis*)、稻象 (rice curculio) (*Echinocnemus scutellatus*)、棉铃象 (*Anthonomus grandis*) 和 hunting billbug (*Sphenophorus venatus*); 拟步甲 (拟步行虫科 (Tenebrionidae)), 例如黄粉甲 (*Tenebrio molitor*) 和赤拟谷盗 (*Tribolium castaneum*); 叶甲 (叶甲科 (Chrysomelidae)), 例如稻负泥虫 (*Oulema oryzae*)、印度黄守瓜 (*Aulacophora femoralis*)、黄曲条菜跳甲 (*Phyllotreta striolata*) 和科罗拉多甲虫 (Colorado beetle) (马铃薯叶甲 (*Leptinotarsa decemlineata*)); 皮蠹 (皮蠹科 (Dermestidae)), 例如小圆皮蠹 (*Anthrenus verbasci*) 和白腹皮蠹 (*Dermestes maculatus*); 窃蠹 (窃蠹科 (Anobiidae)), 例如烟草窃蠹 (*Lasioderma serricornis*); 食植瓢虫属 (*Epilachna*), 例如二十八星瓢虫 (*Epilachna vigintioctopunctata*); 小蠹 (棘胫小蠹科 (Scolytidae)), 例如竹蠹 (褐粉蠹 (*Lyctus brunneus*)) 和纵坑切梢小蠹 (*Tomicus piniperda*); 长蠹 (长蠹科 (Bostrichidae)); 蛛甲 (蛛甲科 (Ptinidae)); 天牛 (天牛科 (Cerambycidae)), 例如白斑星天牛 (*Anoplophora malasiaca*); 叩甲 (*Agriotes* spp.); 毒隐翅虫 (*Paederus fuscipes*) 等;

[0359] 直翅目 (Orthoptera):

[0360] 东亚飞蝗 (*Locusta migratoria*)、非洲蝼蛄 (*Gryllotalpa africana*)、小翅稻蝗 (*Oxya yezoensis*)、日本稻蝗 (*Oxya japonica*)、蟋蟀科 (Grylloidea) 等;

[0361] 蚤目 (Siphonaptera):

[0362] 猫栳头蚤 (*Ctenocephalides felis*)、狗栳头蚤 (*Ctenocephalides canis*)、人蚤 (*Pulex irritans*)、印度鼠蚤 (*Xenopsylla cheopis*) 等;

[0363] 虱目 (Anoplura) :

[0364] 人体虱 (*Pediculus humanus corporis*)、阴虱 (*Phthirus pubis*)、牛血虱 (*Haematopinus eurysternus*)、绵羊毛虱 (*Dalmalinia ovis*)、猪血虱 (*Haematopinus suis*) 等 ;

[0365] 膜翅目 (Hymenoptera) :

[0366] 蚂蚁 (蚁科 (*Formicidae*)), 例如小黄家蚁 (*Monomorium pharaonis*)、日本黑褐蚁 (*Formica fusca japonica*)、黑家蚁 (black house ant) (无毛凹臭蚁 (*Ochetellus glaber*))、双针蚁 (*Pristomyrmex pungens*)、宽结大头蚁 (*Pheidole noda*)、切叶蚁 (*Acromyrmex* spp.) 和火蚁 (*Solenopsis* spp.) ; 胡蜂 (胡蜂科 (*Vespidae*)) ; 肿腿蜂 (肿腿蜂科 (*Bethylidae*)) ; 叶蜂 (叶蜂科 (*Tenthredinidae*)), 例如新疆菜叶蜂 (*Athalia rosae*) 和日本菜叶蜂 (*Athalia japonica*) 等 ;

[0367] 蜚蠊科 (Blattodea) :

[0368] 蜚蠊 (蜚蠊目 (*Blattariae*)), 例如德国小蠊 (*Blattella germanica*)、烟色大蠊 (*Periplaneta fuliginosa*)、美洲大蠊 (*Periplaneta americana*)、褐斑大蠊 (*Periplaneta brunnea*) 和东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*) 等 ;

[0369] 等翅目 (Isoptera) :

[0370] 白蚁 (白蚁科 (*Termitidae*)), 例如地下蚁 (subterranean termites), 例如日本地下蚁 (黄胸散白蚁 (*Reticulitermes speratus*))、台湾家白蚁 (*Coptotermes formosanus*)、干木切白蚁 (*Incisitermes minor*)、Daikokudrywood termite (截头堆砂白蚁 (*Cryptotermes domesticus*))、黑翅土白蚁 (*Odontotermes formosanus*)、恒春新白蚁 (*Neotermes koshunensis*)、赤树白蚁 (*Glyptotermes satsumensis*)、*Glyptotermes nakajimai*、黑树白蚁 (*Glyptotermes fuscus*)、*Glyptotermes kodamai*、*Glyptotermes kushimensis*、日本草白蚁 (*Hodotermopsis japonica*)、广东乳白蚁 (*Coptotermes guangzhouensis*)、*Reticulitermes miyatakei*、北美散白蚁 (*Reticulitermes flavipes amamianus*)、*Reticulitermes kanmonensis* (散白蚁 (*Reticulitermes* sp.))、高山象白蚁 (*Nasutitermes takasagoensis*)、近扭白蚁 (*Pericapritermes nitobei*)、台湾华扭白蚁 (*Sinocapritermes mushae*) 等 ;

[0371] 蜱螨目 (Acarina) :

[0372] 叶螨 (叶螨科 (*Tetranychidae*)), 例如二斑叶螨 (*Tetranychus urticae*)、神泽氏叶螨 (*Tetranychus kanzawai*)、柑桔全爪螨 (*Panonychus citri*)、欧洲红蜘蛛 (*Panonychus ulmi*) 和小爪螨 (*Oligonychus* spp.) ; 瘿螨 (瘿螨科 (*Eriophyidae*)), 例如桔刺皮瘿螨 (*Aculops pelekassi*)、柑桔叶刺瘿螨 (*Phyllocoptruta citri*)、番茄刺皮瘿螨 (*Aculops lycopersici*)、龙首丽瘿螨 (*Calacarus carinatus*)、茶尖叶瘿螨 (*Acaphylla theavagran*)、*Eriophyes chibaensis* 和斯氏针刺瘿螨 (*Aculus schlechtendali*) ; 跗线螨 (跗线螨科 (*Tarsonemidae*)), 例如侧多食跗线螨 (*Polyphagotarsonemus latus*) ; 细须螨 (细须螨科 (*Tenuipalpidae*)), 例如紫红短须螨 (*Brevipalpus phoenicis*) ; 杜克螨科 (*Tuckerellidae*) ; 蜱 (硬蜱科 (*Ixodidae*)), 例如长角血蜱 (*Haemaphysalis longicornis*)、褐黄血蜱 (*Haemaphysalis flava*)、变异革蜱 (*Dermacentor variabilis*)、褐黄血蜱 (*Haemaphysalis flava*)、台湾革蜱 (*Dermacentor taiwanicus*)、变异

革蜱 (*Dermacentor variabilis*)、卵形硬蜱 (*Ixodes ovatus*)、全沟硬蜱 (*Ixodes persulcatus*)、黑腿蜱 (*Ixodesscapularis*)、美洲花蜱 (*Amblyomma americanum*)、微小牛蜱 (*Boophilus microplus*) 和血红扇头蜱 (*Rhipicephalus sanguineus*)；蚤螨科 (*Psoroptidae*)，例如狗耳螨 (*Otodectes cynotis*)；疥螨 (疥螨科 (*Sarcoptidae*))，例如人疥螨 (*Sarcoptes scabiei*)；蠕形螨 (*folicle mites*) (蠕形螨科 (*Demodicidae*))，例如犬蠕形螨 (*Demodex canis*)；蜱螨 (粉螨科 (*Acaridae*))，例如腐食酪螨 (*Tyrophagus putrescentiae*) 和拟食酪螨 (*Tyrophagus similis*)；尘螨 (虱螨科 (*Pyroglyphidae*))，例如粉尘螨 (*Dermatophagoides farinae*) 和屋尘螨 (*Dermatophagoides pteronyssinus*)；肉食螨 (肉食螨科 (*Cheyletidae*))，例如普通肉食螨 (*Cheyletus eruditus*)、马六甲肉食螨 (*Cheyletus malaccensis*) 和 *Cheyletus moorei*；拟寄螨 (*parasitoid mites*) (皮刺螨科 (*Dermanyssidae*))，例如柏氏禽刺螨 (*Ornithonyssus bacoti*)、林禽刺螨 (*Ornithonyssus sylviarum*) 和鸡螨 (*Dermanyssus gallinae*)；恙螨 (恙螨科 (*Trombiculidae*))，例如红纤恙螨 (*Leptotrombidium akamushi*)；蜘蛛 (蜘蛛科 (*Araneae*))，例如日本红螯蛛 (*Chiracanthium japonicum*)、红背蜘蛛 (*Latrodectus hasseltii*) 等；

[0373] 唇足纲 (*Chilopoda*)：*Thereuonema hilgendorfi*、少棘蜈蚣 (*Scolopendra subspinipes*) 等；

[0374] 倍足纲 (*Diplopoda*)：温室马陆 (*Oxidus gracilis*)、*Nedyopus tambanus* 等；

[0375] 等足目 (*Isopoda*)：鼠妇 (*Armadillidium vulgare*) 等；

[0376] 腹足纲 (*Gastropoda*)：*Limax marginatus*、黄蛞蝓 (*Limax flavus*) 等。

[0377] 尽管本发明的杀虫组合物可以是本发明的化合物本身，但是本发明的杀虫组合物通常包含本发明的化合物以及固体载体、液体载体和 / 或气体载体，必要时，还包含表面活性剂或其它药用添加剂，并呈以下形式：乳液剂、油制剂、香波制剂、胶悬剂、粉剂、可湿性粉剂 (*wettable powder*)、颗粒剂、糊剂、微胶囊剂、泡沫制剂、气雾剂、二氧化碳气体制剂、片剂、树脂制剂等。可将本发明的杀虫组合物加工成毒饵、蚊香、电蚊香片、发烟剂 (*smoking agent*)、熏蒸剂或熏片 (*sheet*) 后使用。

[0378] 本发明的杀虫组合物通常含有 0.1-95% (重量) 的本发明化合物。

[0379] 固体载体的实例包括粘土 (例如高岭土、硅藻土、皂土、Fubasami 粘土、酸性粘土等) 的微细粉或颗粒、合成的水合二氧化硅、滑石粉、陶瓷、其它无机矿物 (例如丝云母、石英、硫磺、活性碳、碳酸钙、水合硅石等)、化肥 (例如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、氯化铵、尿素) 等。

[0380] 液体载体的实例包括芳香烃或脂族烃 (例如二甲苯、甲苯、烷基萘、苯基二甲苯基乙烷、煤油、轻质油、己烷、环己烷等)、卤代烃 (例如氯苯、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷等)、醇 (例如甲醇、乙醇、异丙醇、丁醇、己醇、乙二醇等)、醚 (例如乙醚、乙二醇二甲醚、二甘醇一甲醚、二甘醇一乙醚、丙二醇单甲醚、四氢呋喃、二噁烷等)、酯 (例如乙酸乙酯、乙酸丁酯等)、酮 (例如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮、环己酮等)、腈 (例如乙腈、异丁腈等)、亚砷 (例如二甲亚砷等)、酰胺 (例如 N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等)、吡咯烷酮 (例如 N-甲基-2-吡咯烷酮、N-辛基-2-吡咯烷酮等)、碳酸亚丙酯、乳酸乙酯、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮、植物油 (例如豆油、棉籽油等)、植物精油 (例如橙油、海索草油、柠檬油等)、水等。

[0381] 气体载体的实例包括丁烷气体、氯氟烃、LPG(液化石油气)、二甲醚、二氧化碳气体等。

[0382] 表面活性剂的实例包括烷基硫酸盐、烷基磺酸盐、烷基芳基磺酸盐、烷基芳基醚及其聚氧乙烯化衍生物、聚乙二醇醚、多元醇酯和糖醇衍生物。

[0383] 其它药用添加剂的实例包括粘合剂、分散剂、稳定剂等,其具体实例包括酪蛋白、明胶、多糖(例如淀粉、阿拉伯树胶、纤维素衍生物、海藻酸等)、木质素衍生物、皂土、糖、合成的水溶性聚合物(例如聚乙烯醇、聚乙烯吡咯烷酮、聚丙烯酸等)、PAP(酸式磷酸异丙酯)、BHT(2,6-二叔丁基-4-甲基苯酚)、BHA(2-叔丁基-4-甲氧基苯酚和3-叔丁基-4-甲氧基苯酚的混合物)、植物油、矿物油、脂肪酸和脂肪酸酯。

[0384] 树脂制剂的基料的实例包括氯乙烯聚合物、聚氨酯等。必要时,可向基料中加入增塑剂,例如邻苯二甲酸酯(例如邻苯二甲酸二甲酯、邻苯二甲酸二辛酯等)、己二酸、硬脂酸等。可使用常规捏和装置,将本发明的化合物揉捏到基料中,接着通过例如注射成型、挤出成型、压制成型等成型法,来获得树脂制剂。必要时,可经由模压、切割等步骤,将所得树脂制剂做成板、薄膜、带、网、线等形状。可以例如动物项圈、动物耳标(ear tag)、薰片制剂(sheet preparation)、导管(lead)或园艺用桩(horticultural post)的形式,使用这些树脂制剂。

[0385] 毒饵基料的实例包括谷物粉、植物油、糖、结晶纤维素等。必要时,可向基料中加入抗氧化剂(例如二丁基羟基甲苯或去甲二氢愈创木酸)、防腐剂(例如脱氢乙酸)、防止儿童或宠物误食的物质(例如辣椒粉)、诱虫香料(例如干酪香料、洋葱香料)或花生油等。

[0386] 可将本发明的杀虫组合物直接用于例如有害节肢动物和/或有害节肢动物栖息的地方(例如植物、动物、土壤等)。

[0387] 当在农艺或林业方面使用本发明的杀虫组合物用于防治有害生物时,活性成分的用量通常为1-10,000g/ha,优选为10-500g/ha。当本发明的杀虫组合物是乳液剂、可湿性粉剂、胶悬剂或微胶囊剂的形式时,在用水稀释后使用,以使得活性成分的浓度为0.01-1,000ppm。当本发明的杀虫组合物是粉剂或颗粒剂的形式时,通常照原样使用。可将本发明的杀虫组合物照原样或作为稀释液直接喷洒到植物上以防止有害的节肢动物。或者,可以使用本发明的杀虫组合物照原样或作为稀释液处理土壤以防治生活在土壤中的有害节肢动物。种植的苗床或栽植穴或种植中的植物根部(feet)同样可用本发明的杀虫组合物照原样或作为稀释液进行处理。此外,可通过缠绕在植物上、放置在植物附近、放在植物根部的土壤表面等,来使用本发明杀虫组合物的薰片制剂。

[0388] 本发明的杀虫组合物可用于作物植地,例如耕地、水稻田、草地和果园。本发明的杀虫组合物可防治作物植地中的有害节肢动物而不会对栽培在作物植地中的作物造成药剂损害。

[0389] 这类作物的实例包括:

[0390] 农作物:玉米、水稻、小麦、大麦、黑麦、燕麦、高粱、棉花、大豆、花生、sarrazin(生长在北美东部的一种草本作物)、糖甜菜、油菜籽、向日葵、甘蔗、烟草等;

[0391] 蔬菜:茄科(Solanaceae)蔬菜(茄子、番茄、青胡椒、辣椒、马铃薯等)、葫芦科(Cucurbitaceae)蔬菜(黄瓜、南瓜、西葫芦、西瓜、甜瓜等)、十字花科(Cruciferae)蔬菜(日本萝卜(Japanese radish)、芜菁、辣根、球茎甘蓝、中国白菜、甘蓝、黑芥(brown

mustard)、青花椰菜、花椰菜等)、菊科 (Compositae) 蔬菜 (牛蒡、茼蒿、菊芋、莴苣等)、百合科 (Liliaceae) 蔬菜 (大葱、洋葱、大蒜、芦笋等)、伞形科 (Umbelliferae) 蔬菜 (胡萝卜、香芹菜、芹菜、欧洲防风等)、藜科 (Chenopodiaceae) 蔬菜 (菠菜、甜菜等)、唇形科 (Labiatae) 蔬菜 (日本罗勒 (Japanese basil)、薄荷、罗勒等)、草莓、甘薯、薯蓣、芋类等;

[0392] 花卉和观赏植物;

[0393] 观叶植物;

[0394] 果树:仁果类 (苹果、西洋梨、日本梨、木瓜、榲桲等、核果类 (stonefleshy fruit) (桃、李子、油桃、日本李、樱桃、杏、洋李等)、柑橘类植物 (温州蜜柑、橙、柠檬、来檬、葡萄柚等)、坚果类 (栗、胡桃、榛子、杏仁、阿月浑子、腰果、夏威夷果等)、浆果类 (越橘、酸果蔓 (cranberry)、黑莓、悬钩子等)、葡萄、柿子、橄榄、枇杷、香蕉、咖啡、海枣、椰子等;

[0395] 果树以外的树木:茶树、桑树、观花树木和灌木、行道树 (槐树、桦树、山茱萸、桉树、银杏树、紫丁香、枫树、栎树、杨树、紫荆 (cercis)、中国枫香、悬铃木、榉树 (zelkova)、日本崖柏 (Japanese arborvitae)、冷杉树、日本铁杉树 (Japanese hemlock)、刺柏树 (needle juniper)、松树、云杉、紫杉) 等。

[0396] 前述作物包括通过经典育种方法、遗传工程技术等赋予了除草剂抗性的作物,除草剂例如 HPPD 抑制剂例如异噁氟草 (isoxaflutole)、ALS 抑制剂例如咪草烟 (imazethapyr) 或噻磺隆 (thifensulfuron-methyl)、EPSP 合成酶抑制剂、谷氨酰胺合成酶抑制剂、乙酰辅酶 A 羧化酶抑制剂或溴苯腈 (bromoxynil)。

[0397] 通过经典育种方法赋予除草剂抗性的作物的实例包括对咪唑啉酮类除草剂 (例如咪草烟) 有抗性的 Clearfield (注册商标) 油菜、对磺酰脲类 ALS 抑制剂除草剂 (例如噻磺隆) 有抗性的 STS 大豆等。通过经典育种方法赋予乙酰辅酶 A 羧化酶抑制剂 (例如 trioxime 或芳氧基苯氧基丙酸除草剂) 抗性的作物的实例包括 SR 玉米等。例如,赋予乙酰辅酶 A 羧化酶抑制剂抗性的作物参见 Proc. Natl. Acad. Sci. USA 1990, 87, 第 7175-7179 页。另外,抗乙酰辅酶 A 羧化酶抑制剂的突变型乙酰辅酶 A 羧化酶是已知的,例如参见 Weed Science 53:第 728-746 页,2005。当通过遗传工程技术将编码突变型乙酰辅酶 A 羧化酶的基因导入作物中时,或者当将与赋予抗性有关的突变导入编码作物的乙酰辅酶 A 羧化酶的基因中时,便可生产出抗乙酰辅酶 A 羧化酶抑制剂的作物。此外,可通过嵌合法 (chimeraplasty) (参见 Gura T. 1999, Repairing the Genome's Spelling Mistakes (修复基因组的拼写错误), Science 285:316-318), 将引入碱基置换突变的核酸导入作物细胞,以诱导作物的乙酰辅酶 A 羧化酶抑制剂或除草剂所靶定基因的定点氨基酸突变,从而产生抗乙酰辅酶 A 羧化酶抑制剂或除草剂的作物。

[0398] 通过遗传工程技术赋予除草剂抗性的作物的实例包括具有草甘膦 (glyphosate) 或草铵膦 (glufosinate) 抗性的玉米栽培品种。这类玉米栽培品种中有一些以 RoundupReady (注册商标)、LibertyLink (注册商标) 等商品名销售。

[0399] 前述作物包括通过遗传工程技术赋予产生杀虫毒素的能力的作物,例如已知由芽孢杆菌属 (Bacillus) 产生的选择性毒素。

[0400] 通过这类经遗传工程改造的植物产生的杀虫毒素的实例包括由蜡样芽孢杆菌 (Bacillus cereus) 和日本甲虫芽孢杆菌 (Bacillus popilliae) 得到的杀虫蛋白;由苏云金芽孢杆菌 (Bacillus thuringiensis) 得到的 δ -内毒素,例如 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、

Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1 和 Cry9C；由苏云金芽孢杆菌得到的杀虫蛋白，例如 VIP 1、VIP 2、VIP 3 和 VIP 3A；由线虫类得到的杀虫蛋白；由动物产生的毒素，例如蝎毒素、蜘蛛毒素、蜜蜂毒素和昆虫特异性神经毒素；真菌毒素；植物凝集素；凝集素；蛋白酶抑制剂，例如胰蛋白酶抑制剂、丝氨酸蛋白酶抑制剂、patatin、半胱氨酸蛋白酶抑制剂和木瓜蛋白酶抑制剂；核糖体失活蛋白（RIP），例如蓖麻毒蛋白、玉米 RIP、相思豆毒蛋白、肥皂草蛋白和 briodin；类固醇代谢酶，例如 3- 羟基类固醇氧化酶、脱皮甾类 -UDP- 葡萄糖基转移酶和胆固醇氧化酶；脱皮激素抑制剂；HMG-COA 还原酶；离子通道抑制剂，例如钠通道抑制剂和钙通道抑制剂；保幼激素酯酶；利尿激素受体；萜合酶；联苯合酶；几丁质酶；以及葡聚糖酶。

[0401] 通过这类经遗传工程改造的植物产生的杀虫毒素还包括不同杀虫蛋白的杂合毒素，例如 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1 和 Cry9C 等 δ - 内毒素；VIP 1、VIP 2、VIP 3 和 VIP3A 等杀虫蛋白以及其中构成杀虫蛋白的部分氨基酸缺失或经修饰的毒素。杂合毒素通过遗传工程技术将杀虫蛋白的不同结构域结合来制备。其中构成杀虫蛋白的部分氨基酸缺失的毒素的实例包括其中部分氨基酸缺失的 Cry1Ab。其中构成杀虫蛋白的部分氨基酸经修饰的毒素的实例包括其中天然存在的毒素的一个或多个氨基酸被取代的毒素。

[0402] 杀虫毒素和经遗传工程改造的具有产生杀虫毒素能力的作物参见例如 EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451878、WO 03/052073 等。

[0403] 经遗传工程改造的具有产生杀虫毒素能力的作物特别对鞘翅目害虫、双翅目害虫或鳞翅目害虫的攻击具有抵抗力。

[0404] 经遗传工程改造的具有一个或多个抗虫基因从而产生一种或多种杀虫毒素的植物也是已知的，其中一些是市售的。这类经遗传工程改造的植物的实例包括 YieldGard（注册商标）（表达 Cry1Ab 毒素的玉米栽培品种）、YieldGard Rootworm（注册商标）（表达 Cry3Bb1 毒素的玉米栽培品种）、YieldGard Plus（注册商标）（表达 Cry1Ab 和 Cry3Bb1 毒素的玉米栽培品种）、Heculex I（注册商标）（表达 Cry1Fa2 毒素的玉米栽培品种）和用于赋予草铵膦抗性的膦丝菌素 N- 乙酰转移酶（PAT）、NuCOTN33B（注册商标）（表达 Cry1Ac 毒素的棉花栽培品种）、Bollgard I（注册商标）（表达 Cry1Ac 毒素的棉花栽培品种）、Bollgard II（注册商标）（表达 Cry1Ac 和 Cry2Ab 毒素的棉花栽培品种）、VIPCOT（注册商标）（表达 VIP 毒素的棉花栽培品种）、NewLeaf（注册商标）（表达 Cry3A 毒素的马铃薯栽培品种）、NatureGard Agrisure GT Advantage（注册商标）（GA21 草甘膦抗性特征）、Agrisure CB Advantage（注册商标）（Bt11 玉米螟（CB）特征）、Protecta（注册商标）等。

[0405] 前述作物包括通过遗传工程技术赋予了产生抗病原物质能力的作物。

[0406] 抗病原物质的实例包括 PR 蛋白（参见 EP-A-0 392 225 中的 PRP）；离子通道抑制剂，例如钠通道抑制剂和钙通道抑制剂（例如由病毒产生的 KP1、KP4、KP6 毒素等）；萜合酶；联苯合酶；几丁质酶；葡聚糖酶；由微生物产生的物质，例如肽抗生素、含杂环的抗生素；以及参与植物抗病性的蛋白质因子（称为植物抗病基因，参见 WO 03/000906）等。这类抗病原物质和经遗传工程改造的产生抗病原物质的植物参见 EP-A-0 392 225、WO 05/33818、EP-A-0 353 191 等。

[0407] 当本发明的杀虫组合物用于防治流行病时，施药空间活性成分的用量通常为 0.001-10mg/m³，施药平面活性成分的量 0.001-100mg/m²。乳液剂、可湿性粉剂或胶悬剂形

式的杀虫组合物通常在用水稀释后使用,以含有通常为 0.001-10,000ppm 的活性成分。油制剂、气雾剂、发烟剂或毒饵形式的杀虫组合物通常照原样使用。

[0408] 当本发明的杀虫组合物用于防治牲畜(例如牛、马、猪、绵羊、山羊和鸡)或小动物(例如狗、猫、大鼠和小鼠)的体外寄生虫时,可通过兽医领域已知方法将其用于所述动物。准确地讲,当预期用于全身防治时,可作为例如片剂、与饲料的混合物、栓剂或注射剂(例如肌内、皮下、静脉内、腹膜内等)给予本发明的杀虫组合物。当预期用于非全身防治时,使用本发明杀虫组合物的方法包括以油制剂或含水液体制剂的形式用杀虫组合物喷雾、泼淋处理(pour-on treatment)或定点处理(spot-on treatment);以香波制剂的形式用杀虫组合物清洗动物;以及以树脂制剂的形式用杀虫组合物制成的项圈或耳标戴在动物身上。当给予动物时,本发明化合物量的范围通常为 0.1-1,000mg/1 kg 动物体重。

[0409] 本发明的杀虫组合物可与其它杀虫剂、杀线虫剂、杀螨剂、杀真菌剂、除草剂、植物生长调节剂、增效剂、肥料、土壤结构改良剂、动物饲料等混合或组合使用。

[0410] 这类杀虫剂的活性成分的实例包括:

[0411] (1) 有机磷化合物:

[0412] 乙酰甲胺磷(acephate)、磷化铝(aluminum phosphide)、特噻硫磷(butathiofos)、硫线磷(cadusafos)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、毒虫畏(chlorfenvinphos)、毒死蜱(chlorpyrifos)、甲基毒死蜱(chlorpyrifos-methyl)、杀螟腈(cyanophos)(CYAP)、二嗪磷(diazinon)、DCIP(二氯二异丙醚)、除线磷(dichlofenthion)(ECP)、敌敌畏(dichlorvos)(DDVP)、乐果(dimethoate)、甲基毒虫畏(dimethylvinphos)、乙拌磷(disulfoton)、EPN、乙硫磷(ethion)、灭线磷(ethoprophos)、乙噻硫磷(etrifos)、倍硫磷(fenthion)(MPP)、杀螟硫磷(fenitrothion)(MEP)、噻唑磷(fosthiazate)、安硫磷(formothion)、磷化氢(hydrogen phosphide)、异柳磷(isofenphos)、噁唑磷(isoxathion)、马拉硫磷(malathion)、甲亚砷磷(mesulfenfos)、杀扑磷(methidathion)(DMTP)、久效磷(monocrotophos)、二溴磷(naled)(BRP)、异砷磷(oxydeprofos)(ESP)、对硫磷(parathion)、伏杀硫磷(phosalone)、亚胺硫磷(phosmet)(PMP)、甲基嘧啶磷(pirimiphos-methyl)、吡啶硫磷(pyridafenthion)、喹硫磷(quinalphos)、稻丰散(phenthoate)(PAP)、丙溴磷(profenofos)、丙虫磷(propaphos)、丙硫磷(prothiofos)、吡唑硫磷(pyraclorfos)、蔬果磷(salithion)、硫丙磷(sulprofos)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、双硫磷(temephos)、杀虫畏(tetrachlorvinphos)、特丁硫磷(terbufos)、甲基乙拌磷(thiometon)、敌百虫(trichlorphon)(DEP)、蚜灭磷(vamidothion)、甲拌磷(phorate)、硫线磷等;

[0413] (2) 氨基甲酸酯化合物:

[0414] 棉铃威(alanycarb)、噁虫威(bendiocarb)、丙硫克百威(benfuracarb)、BPMC、甲萘威(carbaryl)、克百威(carbofuran)、丁硫克百威(carbosulfan)、除线威(cloethocarb)、乙硫苯威(ethiofencarb)、仲丁威(fenobucarb)、苯硫威(fenothiocarb)、苯氧威(fenoxycarb)、呋线威(furathiocarb)、异丙威(isoprocab)(MIPC)、速灭威(metolcarb)、灭多威(methomyl)、甲硫威(methiocarb)、NAC、杀线威(oxamyl)、抗蚜威(pirimicarb)、残杀威(propoxur)(PHC)、XMC、硫双威(thiodicarb)、灭杀威(xylylcarb)、涕灭威(aldicarb)等;

[0415] (3) 合成拟除虫菊酯化合物：

[0416] 氟丙菊酯 (acrinathrin)、烯丙菊酯 (allethrin)、benfluthrin、 β -氟氯氰菊酯 (beta-cyfluthrin)、联苯菊酯 (bifenthrin)、乙氰菊酯 (cycloprothrin)、氟氯氰菊酯 (cyfluthrin)、氯氟氰菊酯 (cyhalothrin)、氯氰菊酯 (cypermethrin)、右旋烯炔菊酯 (empenthrin)、溴氰菊酯 (deltamethrin)、S-氰戊菊酯 (esfenvalerate)、醚菊酯 (ethofenprox)、甲氰菊酯 (fenpropathrin)、氰戊菊酯 (fenvalerate)、氟氰戊菊酯 (flucythrinate)、三氟醚菊酯 (flufenoprox)、氟氯苯菊酯 (flumethrin)、氟胺氰菊酯 (fluvalinate)、苧螨醚 (halfenprox)、炔咪菊酯 (imiprothrin)、氯菊酯 (permethrin)、右旋炔丙菊酯 (prallethrin)、除虫菊素 (pyrethrins)、苧呋菊酯 (resmethrin)、 σ -氯氰菊酯、氟硅菊酯 (silafluofen)、七氟菊酯 (tefluthrin)、四溴菊酯 (tralomethrin)、四氟苯菊酯 (transfluthrin)、胺菊酯 (tetramethrin)、苯醚菊酯 (phenothrin)、苯醚氰菊酯 (cyphenothrin)、 α -氯氰菊酯、 ζ -氯氰菊酯、 λ -氯氟氰菊酯、 γ -氯氟氰菊酯、炔呋菊酯 (furamethrin)、 τ -氟胺氰菊酯、metofluthrin、2,2-二甲基-3-(1-丙烯基)环丙烷甲酸 2,3,5,6-四氟-4-甲基苧酯、2,2-二甲基-3-(2-甲基-1-丙烯基)环丙烷甲酸 2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苧酯、2,2-二甲基-3-(2-氰基-1-丙烯基)环丙烷甲酸 2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苧酯、2,2,3,3-四甲基环丙烷甲酸 2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苧酯等；

[0417] (4) 沙蚕毒素化合物：

[0418] 杀螟丹 (cartap)、杀虫磺 (bensultap)、杀虫环 (thiocyclam)、杀虫单 (monosultap)、杀虫双 (bisultap) 等；

[0419] (5) 新烟碱类化合物：

[0420] 吡虫啉 (imidacloprid)、烯啶虫胺 (nitenpyram)、啉虫脒 (acetamiprid)、噻虫嗪 (thiamethoxam)、噻虫啉 (thiacloprid)、呋虫胺 (dinotefuran)、噻虫胺 (clothianidin) 等；

[0421] (6) 苯甲酰脲化合物：

[0422] 氟啶脲 (chlorfluazuron)、双二氟虫脲 (bistrifluron)、丁醚脲 (diafenthiuron)、除虫脲 (diflubenzuron)、啉蜱脲 (fluazuron)、氟环脲 (flucycloxuron)、氟虫脲 (flufenoxuron)、氟铃脲 (hexaflumuron)、虱螨脲 (lufenuron)、氟酰脲 (novaluron)、多氟脲 (noviflumuron)、氟苯脲 (teflubenzuron)、杀铃脲 (triflumuron)、triazuron 等；

[0423] (7) 苯基吡唑化合物：

[0424] 乙酰虫脒 (acetoprole)、乙虫脒 (ethiprole)、氟虫脒 (fipronil)、氟吡唑虫 (vaniliprole)、pyriprole、pyrafluprole 等；

[0425] (8) Bt 毒素杀虫剂：

[0426] 由苏云金芽孢杆菌所获得的活孢子和由苏云金芽孢杆菌所产生的晶体毒素及其混合物；

[0427] (9) 脒化合物：

[0428] 环虫酰脒 (chromafenozide)、氯虫酰脒 (halofenozide)、甲氧虫酰脒 (methoxyfenozide)、虫酰脒 (tebufenozide) 等；

[0429] (10) 有机氯化合物：

[0430] 艾氏剂 (aldrin)、狄氏剂 (dieldrin)、遍地克 (dienochlor)、硫丹 (endosulfan)、甲氧滴滴涕 (methoxychlor) 等；

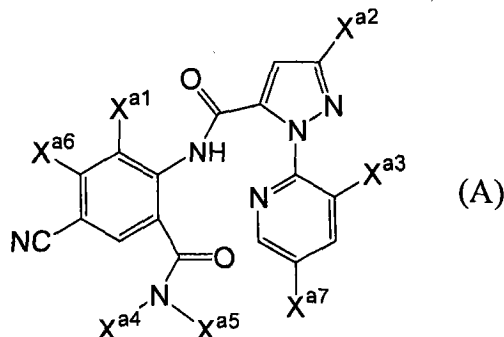
[0431] (11) 天然杀虫剂：

[0432] 机油、硫酸烟碱等；

[0433] (12) 其它杀虫剂：

[0434] 阿维菌素-B (avermectin-B)、溴螨酯 (bromopropylate)、噻嗪酮 (buprofezin)、溴虫清 (chlorphenapyr)、灭蝇胺 (cyromazine)、D-D (1,3-二氯丙烯)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐 (emamectin-benzoate)、啮螨醚 (fenazaquin)、吡氟硫磷 (flupyrazofos)、烯虫乙酯 (hydroprene)、烯虫酯 (methoprene)、茚虫威 (indoxacarb)、噁虫酮 (metoxadiazone)、密比霉素-A (milbemycin-A)、吡蚜酮 (pymetrozine)、啖虫醚 (pyridalyl)、吡丙醚 (pyriproxyfen)、多杀菌素 (spinosad)、氟虫胺 (sulfluramid)、啖虫酰胺 (tolfenpyrad)、啖蚜威 (triazamate)、氟虫酰胺 (flubendiamide)、lepimectin、砷酸、benclothiaz、氰氨化钙、石硫合剂 (calcium polysulfide)、氯丹 (chlordan)、DDT、DSP、flufenerim、氟啖虫酰胺 (flonicamid)、flurimfen、伐虫脒 (formetanate)、安百亩 (metam-ammonium)、威百亩 (metam-sodium)、溴甲烷 (methyl bromide)、油酸钾、protrifenbute、spiromesifen、硫磺 (sulfur)、氰氟虫腙 (metaflumizone)、螺虫乙酯 (spirotetramat)、pyrifluquinazone、spinetoram、氯虫苯甲酰胺 (chlorantraniliprole)、tralopyril、由下式 (A) 表示的化合物：

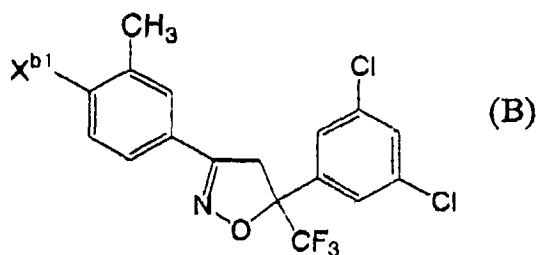
[0435]



[0436] 其中 X^{a1} 表示甲基、氯、溴或氟， X^{a2} 表示氟、氯、溴、C1-C4 卤代烷基或 C1-C4 卤代烷氧基， X^{a3} 表示氟、氯或溴， X^{a4} 表示任选取代的 C1-C4 烷基、任选取代的 C3-C4 烯基、任选取代的 C3-C4 炔基、任选取代的 C3-C5 环烷基或氢， X^{a5} 表示氢或甲基， X^{a6} 表示氢、氟或氯， X^{a7} 表示氢、氟或氯；

[0437] 由下式 (B) 表示的化合物：

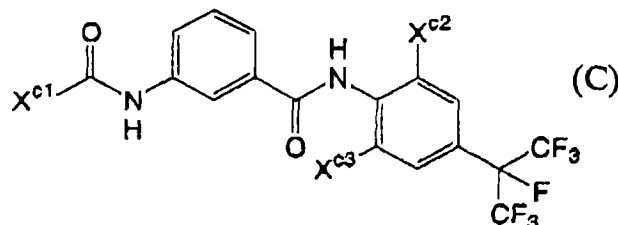
[0438]



[0439] 其中 X^{b1} 表示 $X^{b2}-NH-C(=O)$ 、 $X^{b2}-C(=O)-NH$ 、 $X^{b3}-S(O)$ 、任选取代的吡咯-1-基、任选取代的咪唑-1-基、任选取代的吡唑-1-基或任选取代的 1,2,4-三唑-1-基, X^{b2} 表示任选取代的 C1-C4 卤代烷基例如 2,2,2-三氟乙基或任选取代的 C3-C6 环烷基例如环丙基, X^{b3} 表示任选取代的 C1-C4 烷基例如甲基;

[0440] 由下式 (C) 表示的化合物:

[0441]



[0442] 其中 X^{c1} 表示任选取代的 C1-C4 烷基例如 3,3,3-三氟丙基、任选取代的 C1-C4 烷氧基例如 2,2,2-三氯乙氧基或任选取代的苯基例如苯基, X^{c2} 表示甲基或三氟甲硫基, X^{c3} 表示甲基或卤素等。

[0443] 杀螨剂的活性成分的实例包括灭螨醌 (acequinocyl)、双甲脒 (amitraz)、苯螨特 (benzoximate)、联苯肼酯 (bifenazate)、溴螨酯、灭螨猛 (chinomethionat)、乙酯杀螨醇 (chlorobenzilate)、CPCBS(杀螨酯 (chlorfenson))、四螨嗪 (clofentezine)、cyflumetofen、三氯杀螨醇 (kelthane/dicofol)、乙螨唑 (etoxazole)、苯丁锡 (fenbutatin oxide)、苯硫威、唑螨酯 (fenpyroximate)、嘧螨酯 (fluacrypyrim)、fluproxyfen、噻螨酮 (hexythiazox)、炔螨特 (propargite) (BPPS)、杀螨霉素 (polynactins)、哒螨灵 (pyridaben)、嘧螨醚 (pyrimidifen)、吡螨胺 (tebufenpyrad)、三氯杀螨砜 (tetradifon)、螺螨酯 (spirodiclofen)、spiromesifen、螺虫乙酯、amidoflumet、cyenopyrafen 等。

[0444] 杀线虫剂的实例包括 DCIP、噻唑磷、盐酸左旋咪唑 (levamisole hydrochloride)、异硫氰酸甲酯 (methylisothiocyanate)、酒石酸莫仑太尔 (morantel tartarate)、imicyafos 等。

[0445] 这类杀真菌剂的活性成分的实例包括甲氧基丙烯酸酯 (strobilurin) 化合物, 例如嘧菌酯 (azoxystrobin); 有机磷酸酯化合物, 例如甲基立枯磷 (tolclofos-methyl); 唑类化合物, 例如氟菌唑 (triflumizole)、稻瘟酯 (pefurazoate) 和苯醚甲环唑 (difenoconazole); 四氯苯酞 (fthalide)、氟酰胺 (flutolanil)、有效霉素 (validamycin)、烯丙苯噻唑 (probenazole)、哒菌酮 (diclomezine)、戊菌隆 (pencycuron)、棉隆 (dazomet)、春雷霉素 (kasugamycin)、IBP、咯嗪酮 (pyroquilon)、啮菌酮 (oxolinic acid)、三环唑 (tricyclazole)、啮菌脲 (ferimzone)、灭锈胺 (mepronil)、EDDP、稻瘟灵 (isoprothiolane)、环丙酰菌胺 (carpropamid)、双氯氰菌胺 (diclocymet)、呋吡菌胺 (furametpyr)、咯菌腈 (fludioxonil)、腐霉利 (procymidone) 和乙霉威 (diethofencarb)。

实施例

[0446] 在下文中, 将通过下列制备实施例、制剂实施例和试验实施例对本发明进行更详

细说明,但是本发明不限于这些实施例。

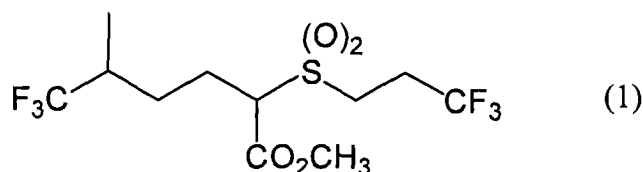
[0447] 下面首先描述了本发明化合物的制备实施例。

[0448] 制备实施例 1

[0449] 在室温下,向 2.0g 对甲苯磺酸 4,4,4-三氟-3-甲基丁酯和 1.6g (3,3,3-三氟丙基磺酰基)乙酸甲酯的 50ml 二甲亚砜溶液中加入 0.3g 氢化钠(60%的油溶液)。将反应混合物加热至 60℃,在同一温度下搅拌 20 小时,然后使之静置冷却至室温附近。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 0.83g 6,6,6-三氟-5-甲基-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)己酸甲酯(下文亦称本发明化合物(1))。

[0450] 本发明化合物(1):

[0451]



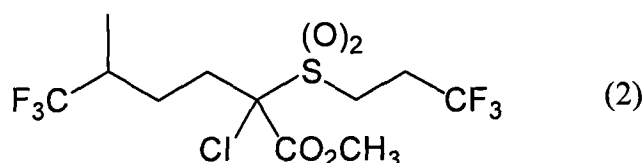
[0452] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS): δ (ppm) 3.88 (s, 3H), 3.75-3.85 (m, 1H), 3.28-3.49 (m, 2H), 1.33-2.78 (m, 7H), 1.15 (d, 3H)。

[0453] 制备实施例 2

[0454] 在室温下,向 0.7g 本发明化合物(1)的 30ml 四氢呋喃溶液中加入 0.1g 氢化钠(60%的油溶液),然后在同一温度下搅拌 0.5 小时。在室温下,向混合物中加入 0.3g N-氯代琥珀酰亚胺,然后搅拌 10 小时。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 0.70g 2-氯-6,6,6-三氟-5-甲基-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)己酸甲酯(下文亦称本发明化合物(2))。

[0455] 本发明化合物(2):

[0456]



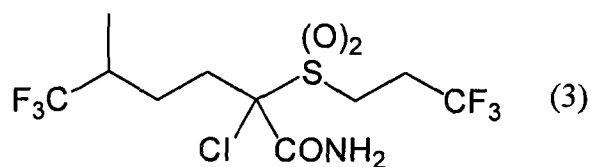
[0457] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS): δ (ppm) 3.96 (s, 3H), 3.50-3.86 (m, 2H), 1.42-2.81 (m, 7H), 1.18 (dd, 3H)。

[0458] 制备实施例 3

[0459] 在室温下,向 0.6g 本发明化合物(2)的 30ml 甲醇溶液中加入 0.6ml 氨(7M 甲醇溶液),然后在同一温度下搅拌 10 小时。减压浓缩反应混合物。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 0.45g 2-氯-6,6,6-三氟-5-甲基-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)己酰胺(下文亦称本发明化合物(3))。

[0460] 本发明化合物(3):

[0461]



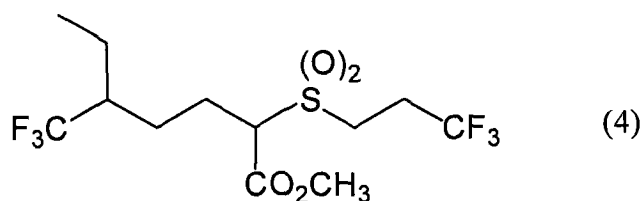
[0462] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 6.88 (bs, 1H), 5.99 (bs, 1H), 3.33–3.68 (m, 2H), 1.35–2.81 (m, 7H), 1.17 (d, 3H)。

[0463] 制备实施例 4

[0464] 在室温下,向 2.7g 对甲苯磺酸 3-(三氟甲基)戊酯和 2.0g (3,3,3-三氟丙基磺酰基)乙酸甲酯的 30ml 二甲亚砜溶液中加入 1.2g 碳酸钾。将反应混合物加热至 60°C ,在同一温度下搅拌 4 天,然后使之静置冷却至室温附近。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 1.20g 5-三氟甲基-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)庚酸甲酯(下文亦称本发明化合物(4))。

[0465] 本发明化合物(4) :

[0466]



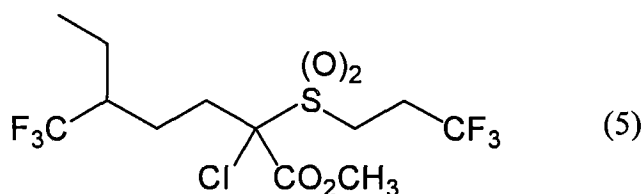
[0467] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 3.89 (s, 3H), 3.78–3.84 (m, 1H), 3.28–3.50 (m, 2H), 1.43–2.78 (m, 9H), 1.00 (dt, 3H)。

[0468] 制备实施例 5

[0469] 在室温下,向 1.1g 本发明化合物(4)的 30ml 四氢呋喃溶液中加入 0.1g 氢化钠(60%的油溶液),然后在同一温度下搅拌 0.5 小时。在室温下,向混合物中加入 0.4g N-氯代琥珀酰亚胺后搅拌 1 小时。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 0.40g 2-氯-5-三氟甲基-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)庚酸甲酯(下文亦称本发明化合物(5))。

[0470] 本发明化合物(5) :

[0471]



[0472] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 3.96 (s, 3H), 3.50–3.85 (m, 2H), 1.43–2.80 (m, 9H), 1.01 (t, 3H)。

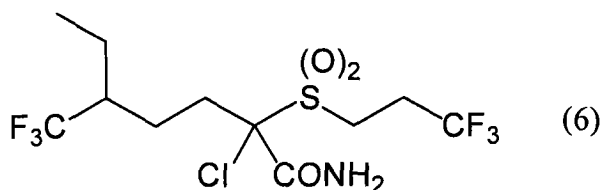
[0473] 制备实施例 6

[0474] 在室温下,向 0.9g 本发明化合物(5)的 20ml 甲醇溶液中加入 0.9ml 氨(7M 甲醇溶液),在同一温度下搅拌 16 小时。减压浓缩反应混合物。所得残余物用硅胶色谱法进行

处理,得到 0.65g 2-氯-5-三氟甲基-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)庚酰胺(下文亦称本发明化合物(6))。

[0475] 本发明化合物(6):

[0476]



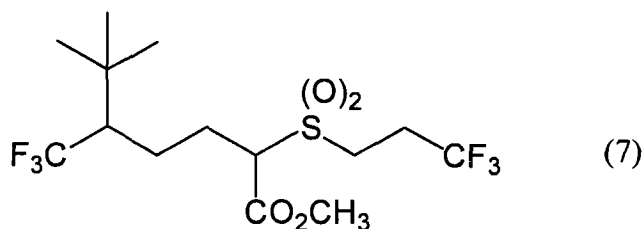
[0477] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS): δ (ppm) 6.88 (bs, 1H), 6.03 (bs, 1H), 3.31-3.78 (m, 2H), 1.42-2.80 (m, 9H), 1.01 (t, 3H)。

[0478] 制备实施例 7

[0479] 在室温下,向 2.9g 对甲苯磺酸 4,4-二甲基-3-(三氟甲基)戊酯和 2.0g (3,3,3-三氟丙基磺酰基)乙酸甲酯的 30ml 二甲亚砜溶液中加入 1.2g 碳酸钾。将反应混合物加热至 90°C ,在同一温度下搅拌 6 小时,然后使之静置冷却至室温附近。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 2.00g 6,6-二甲基-5-三氟甲基-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)庚酸甲酯(下文亦称本发明化合物(7))。

[0480] 本发明化合物(7):

[0481]



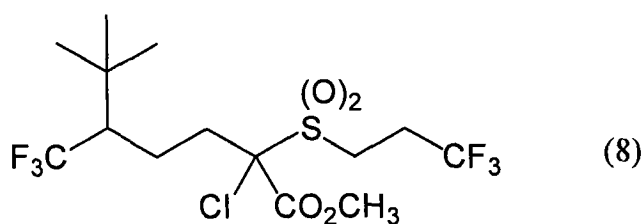
[0482] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS): δ (ppm) 3.89 (s, 3H), 3.78-3.89 (m, 1H), 3.24-3.50 (m, 2H), 1.49-2.78 (m, 7H), 1.03 (s, 9H)。

[0483] 制备实施例 8

[0484] 在室温下,向 1.9g 本发明化合物(7)的 30ml 四氢呋喃溶液中加入 0.2g 氢化钠(60%的油溶液),在同一温度下搅拌 0.5 小时。在室温下,向混合物中加入 0.6g N-氯代琥珀酰亚胺后搅拌 1 小时。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 0.40g 2-氯-6,6-二甲基-5-三氟甲基-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)庚酸甲酯(下文亦称本发明化合物(8))。

[0485] 本发明化合物(8):

[0486]



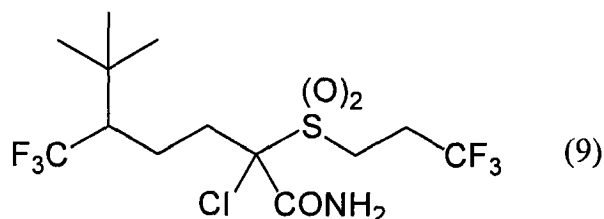
[0487] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 3.95 (s, 3H), 3.49–3.83 (m, 2H), 1.60–2.90 (m, 7H), 1.05 (s, 9H)。

[0488] 制备实施例 9

[0489] 在室温下, 向 1.0g 本发明化合物 (8) 的 50ml 甲醇溶液中加入 1.0ml 氨 (7M 甲醇溶液), 在同一温度下搅拌 18 小时。减压浓缩反应混合物。所得残余物用硅胶色谱法进行处理, 得到 0.53g 2-氯-6,6-二甲基-5-(三氟甲基)-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)庚酰胺 (下文亦称本发明化合物 (9))。

[0490] 本发明化合物 (9) :

[0491]



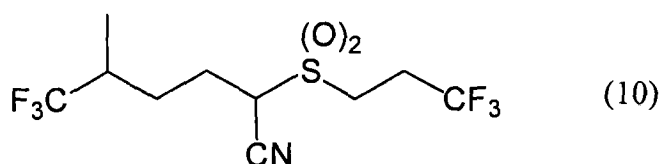
[0492] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 6.88 (bs, 1H), 5.86 (bs, 1H), 3.33–3.78 (m, 2H), 1.50–2.89 (m, 7H), 1.05 (s, 9H)。

[0493] 制备实施例 10

[0494] 在室温下, 向 1.0g 对甲苯磺酸 4,4,4-三氟-3-甲基丁酯和 0.7g (3,3,3-三氟丙基磺酰基)乙腈的 50ml 二甲亚砜溶液中加入 0.5g 碳酸钾, 然后在同一温度下搅拌 16 小时。向反应混合物中加入 10% 盐酸, 然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤, 经无水硫酸镁干燥, 然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理, 得到 0.50g 6,6,6-三氟-5-甲基-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)己腈 (下文亦称本发明化合物 (10))。

[0495] 本发明化合物 (10) :

[0496]



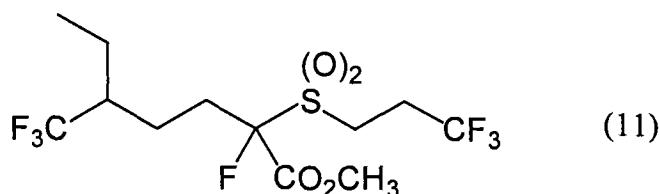
[0497] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 3.88–3.95 (m, 1H), 3.35–3.60 (m, 2H), 1.50–2.96 (m, 7H), 1.20 (d, 3H)。

[0498] 制备实施例 11

[0499] 在室温下, 向 1.0g 本发明化合物 (4) 的 30ml 四氢呋喃溶液中加入 0.1g 氢化钠 (60% 的油溶液)。将反应混合物在同一温度下搅拌 0.5 小时。向反应混合物中加入 0.8g 三氟甲磺酸 1-氟-2,4,6-三甲基吡啶鎓, 然后搅拌 1 小时。向其中加入 10% 盐酸, 然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤, 经无水硫酸镁干燥, 然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理, 得到 0.77g 2-氟-5-(三氟甲基)-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)庚酸甲酯 (下文亦称本发明化合物 (11))。

[0500] 本发明化合物 (11) :

[0501]



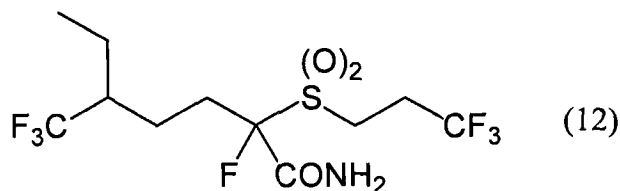
[0502] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 3.99 (s, 3H), 3.24–3.52 (m, 2H), 2.58–2.80 (m, 2H), 1.42–2.14 (m, 7H), 1.00 (t, 3H)。

[0503] 制备实施例 12

[0504] 在室温下, 向 0.6g 本发明化合物 (11) 的 30ml 甲醇溶液中加入 0.6ml 氨 (7M 甲醇溶液), 然后在同一温度下搅拌 3 天。减压浓缩反应混合物。所得残余物用硅胶色谱法进行处理, 得到 0.32g 2-氟-5-(三氟甲基)-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)庚酰胺 (下文亦称本发明化合物 (12))。

[0505] 本发明化合物 (12) :

[0506]



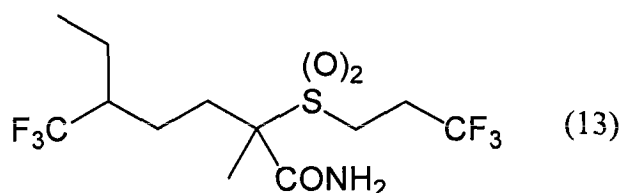
[0507] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 6.58 (bs, 1H), 6.16 (bs, 1H), 3.26–3.53 (m, 2H), 1.43–2.80 (m, 9H), 1.00 (d, 3H)。

[0508] 制备实施例 13

[0509] 在室温下, 向 1.1g 本发明化合物 (4) 和 0.4g 碘甲烷的 30ml N, N-二甲基甲酰胺溶液中加入 0.1g 氢化钠 (60% 的油溶液)。将反应混合物在同一温度下搅拌 1 小时。向反应混合物中加入 10% 盐酸, 然后用乙酸乙酯萃取。有机层依次用 10% 盐酸和饱和氯化钠水溶液洗涤, 经无水硫酸镁干燥, 然后减压浓缩。将所得残余物溶于 20ml 甲醇。在室温下, 向该溶液中加入氢氧化钾水溶液 (0.5g 氢氧化钾的 5ml 水溶液的全部溶液), 在同一温度下搅拌 6 小时。向反应混合物中加入 10% 盐酸, 然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤, 经无水硫酸镁干燥, 然后减压浓缩。将残余物溶于 20ml 二氯甲烷。在室温下, 向该溶液中依次滴加 2 滴 N, N-二甲基甲酰胺和 0.2ml 草酰氯。将反应混合物在同一温度下搅拌 2 小时, 然后减压浓缩。在室温下, 将所得残余物溶于 20ml 四氢呋喃, 向其中滴加 0.3g 30% (重量/重量) 氨水溶液。将反应混合物在同一温度下搅拌 10 小时。向其中加入饱和氯化铵水溶液。混合物用乙酸乙酯萃取, 然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理, 得到 0.30g 2-甲基-5-(三氟甲基)-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)庚酰胺 (下文亦称本发明化合物 (13))。

[0510] 本发明化合物 (13) :

[0511]



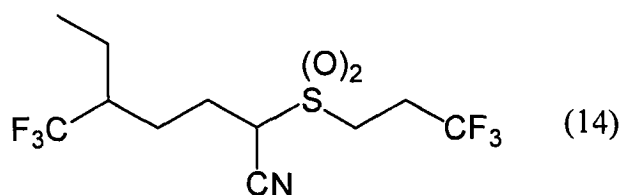
[0512] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 6.57 (bs, 1H), 5.69 (bs, 1H), 3.13–3.42 (m, 2H), 2.60–2.77 (m, 2H), 1.40–2.36 (m, 7H), 1.67 (s, 3H), 1.00 (s, 3H)。

[0513] 制备实施例 14

[0514] 在室温下, 向 3.0g 甲磺酸 3-(三氟甲基)戊酯和 2.6g (3,3,3-三氟丙基磺酰基)乙腈的 50ml 二甲亚砜溶液中加入 1.8g 碳酸钾, 加热至 60°C , 然后在同一温度下搅拌 3 天。使反应混合物静置冷却至室温附近。向反应混合物中加入 10% 盐酸, 然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤, 经无水硫酸镁干燥, 然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理, 得到 3.00g 5-(三氟甲基)-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)庚腈 (下文亦称本发明化合物 (14))。

[0515] 本发明化合物 (14) :

[0516]



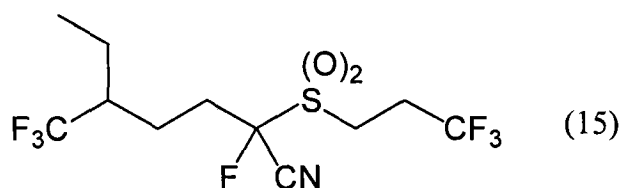
[0517] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 3.91 (dd, 1H), 3.37–3.60 (m, 2H), 1.45–2.98 (m, 9H), 1.03 (t, 3H)。

[0518] 制备实施例 15

[0519] 在室温下, 向 0.9g 本发明化合物 (14) 的 20ml 四氢呋喃溶液中加入 0.1g 氢化钠 (60% 的油溶液)。将反应混合物在同一温度下搅拌 0.5 小时。在同一温度下, 向反应混合物中加入 0.8g 三氟甲磺酸 1-氟-2,4,6-三甲基吡啶鎓, 然后搅拌 2 小时。向其中加入 10% 盐酸, 然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤, 经无水硫酸镁干燥, 然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理, 得到 0.50g 2-氟-5-(三氟甲基)-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)庚腈 (下文亦称本发明化合物 (15))。

[0520] 本发明化合物 (15) :

[0521]



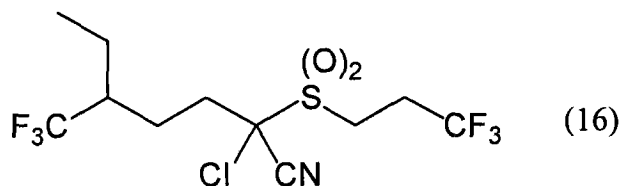
[0522] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 3.50–3.65 (m, 2H), 1.46–2.90 (m, 9H), 1.04 (t, 3H)。

[0523] 制备实施例 16

[0524] 在室温下, 向 0.9g 本发明化合物 (14) 的 20ml 四氢呋喃溶液中加入 0.1g 氢化钠 (60% 的油溶液)。将反应混合物在同一温度下搅拌 0.5 小时。在同一温度下, 向反应混合物中加入 0.3g N-氯代琥珀酰亚胺, 然后搅拌 2 小时。向其中加入 10% 盐酸, 然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤, 经无水硫酸镁干燥, 然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理, 得到 0.52g 2-氯-5-(三氟甲基)-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)庚腈 (下文亦称本发明化合物 (16))。

[0525] 本发明化合物 (16) :

[0526]

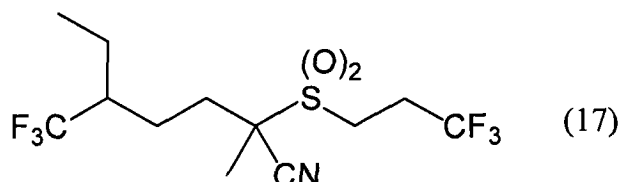
[0527] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 3. 63-3. 82 (m, 2H) , 1. 45-2. 90 (m, 9H) , 1. 04 (t, 3H) 。

[0528] 制备实施例 17

[0529] 在室温下, 向 0. 9g 本发明化合物 (14) 和 0. 4g 碘甲烷的 20ml N, N- 二甲基甲酰胺溶液中加入 0. 1g 氢化钠 (60% 的油溶液) 。将反应混合物在同一温度下搅拌 20 小时。向反应混合物中加入 10% 盐酸, 然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤, 经无水硫酸镁干燥, 然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理, 得到 0. 64g 2- 甲基 -5-(三氟甲基)-2-(3, 3, 3- 三氟丙基磺酰基) 庚腈 (下文亦称本发明化合物 (17)) 。

[0530] 本发明化合物 (17) :

[0531]

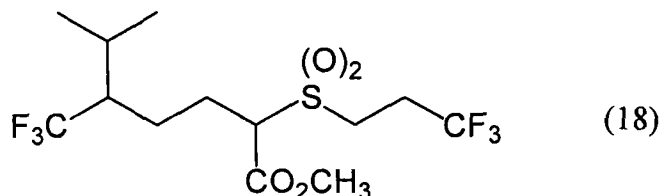
[0532] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 3. 35-3. 53 (m, 2H) , 1. 42-2. 98 (m, 9H) , 1. 80 (s, 3H) , 1. 03 (t, 3H) 。

[0533] 制备实施例 18

[0534] 在室温下, 向 5. 0g 甲磺酸 4- 甲基 -3-(三氟甲基) 戊酯和 4. 7g (3, 3, 3- 三氟丙基磺酰基) 乙酸甲酯的 100ml 二甲亚砜溶液中加入 2. 8g 碳酸钾。将反应混合物加热至 60°C , 在同一温度下搅拌 3 天, 然后使之静置冷却至室温附近。向反应混合物中加入 10% 盐酸, 然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤, 经无水硫酸镁干燥, 然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理, 得到 4. 10g 6- 甲基 -5-(三氟甲基)-2-(3, 3, 3- 三氟丙基磺酰基) 庚酸甲酯 (下文亦称本发明化合物 (18)) 。

[0535] 本发明化合物 (18) :

[0536]

[0537] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 3. 89 (s, 3H) , 3. 78-3. 85 (m, 1H) , 3. 25-3. 50 (m, 2H) , 1. 48-2. 98 (m, 8H) , 0. 89-1. 02 (m, 6H) 。

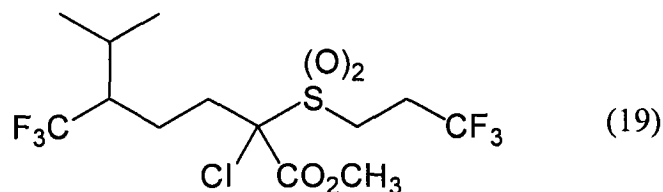
[0538] 制备实施例 19

[0539] 在室温下, 向 4. 0g 本发明化合物 (18) 的 100ml 四氢呋喃溶液中加入 0. 4g 氢化钠 (60% 的油溶液) 。将反应混合物在同一温度下搅拌 0. 5 小时。向反应混合物中加入 1. 4g N- 氯代琥珀酰亚胺, 然后搅拌 1 小时。向其中加入 10% 盐酸, 然后用乙酸乙酯萃取。有机

层用饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 2.83g 2-氯-6-甲基-5-(三氟甲基)-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)庚酸甲酯(下文亦称本发明化合物(19))。

[0540] 本发明化合物(19):

[0541]



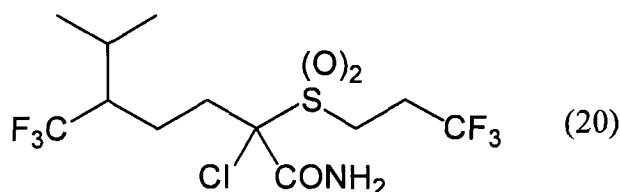
[0542] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS): δ (ppm) 3.95 (s, 3H), 3.49–3.84 (m, 2H), 1.58–2.84 (m, 8H), 0.93–1.06 (m, 6H)。

[0543] 制备实施例 20

[0544] 在室温下,向 1.0g 本发明化合物(19)的 50ml 甲醇溶液中加入 1.0ml 氨(7M 甲醇溶液),然后在同一温度下搅拌 16 小时。减压浓缩反应混合物。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 0.75g 2-氯-6-甲基-5-(三氟甲基)-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)庚酰胺(下文亦称本发明化合物(20))。

[0545] 本发明化合物(20):

[0546]



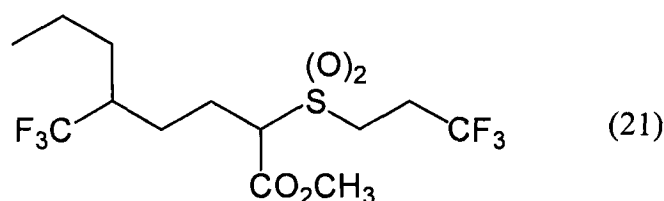
[0547] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS): δ (ppm) 6.87 (bs, 1H), 5.94 (bs, 1H), 3.35–3.76 (m, 2H), 1.48–2.82 (m, 8H), 0.94–1.05 (m, 6H)。

[0548] 制备实施例 21

[0549] 在室温下,向 3.0g 甲磺酸 3-(三氟甲基)-己酯和 2.8g (3,3,3-三氟丙基磺酰基)乙酸甲酯的 50ml 二甲亚砜溶液中加入 1.7g 碳酸钾。将反应混合物加热至 60°C ,在同一温度下搅拌 2 天,然后使之静置冷却至室温附近。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 1.90g 5-(三氟甲基)-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)辛酸甲酯(下文亦称本发明化合物(21))。

[0550] 本发明化合物(21):

[0551]



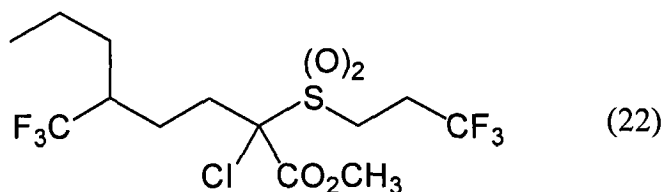
[0552] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS): δ (ppm) 3.89 (s, 3H), 3.78–3.85 (m, 1H), 3.25–3.50 (m, 2H), 1.30–2.78 (m, 11H), 0.94 (t, 3H)。

[0553] 制备实施例 22

[0554] 在室温下,向 1.7g 本发明化合物 (21) 的 50ml 四氢呋喃溶液中加入 0.2g 氢化钠 (60% 的油溶液)。将反应混合物在同一温度下搅拌 0.5 小时。向反应混合物中加入 0.6g N-氯代琥珀酰亚胺,然后搅拌 2 小时。向其中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 1.20g 2-氯-5-(三氟甲基)-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)辛酸甲酯(下文亦称本发明化合物 (22))。

[0555] 本发明化合物 (22) :

[0556]



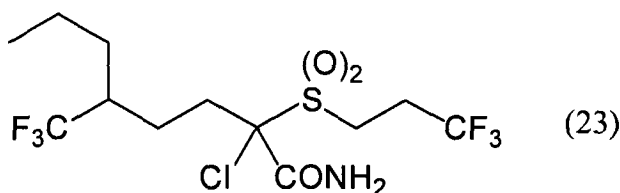
[0557] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 3.95 (s, 3H), 3.50–3.80 (m, 2H), 1.30–2.80 (m, 2H), 1.30–2.80 (m, 11H), 0.95 (t, 3H)。

[0558] 制备实施例 23

[0559] 在室温下,向 1.0g 本发明化合物 (22) 的 30ml 甲醇溶液中加入 1.0 ml 氨 (7M 甲醇溶液),然后在同一温度下搅拌 4 天。减压浓缩反应混合物。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 0.60g 2-氯-5-(三氟甲基)-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)辛酰胺(下文亦称本发明化合物 (23))。

[0560] 本发明化合物 (23) :

[0561]



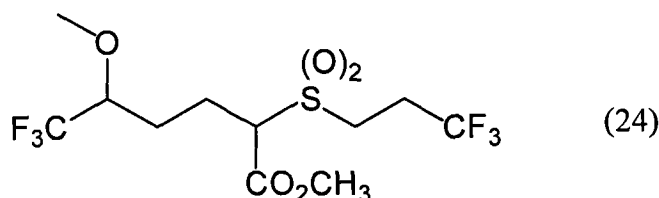
[0562] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 6.87 (bs, 1H), 5.95 (bs, 1H), 3.34–3.78 (m, 2H), 1.32–2.80 (m, 11H), 0.95 (d, 3H)。

[0563] 制备实施例 24

[0564] 在室温下,向 1.0g 对甲苯磺酸 4,4,4-三氟-3-甲氧基-丁酯和 0.8g (3,3,3-三氟丙基磺酰基)乙酸甲酯的 50ml 二甲亚砜溶液中加入 0.4g 碳酸钾,在室温下搅拌 4 天。将反应混合物加热至 60°C,在同一温度下搅拌 20 小时,然后使之静置冷却至室温附近。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 0.62g 6,6,6-三氟-5-甲氧基-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)己酸甲酯(下文亦称本发明化合物 (24))。

[0565] 本发明化合物 (24) :

[0566]



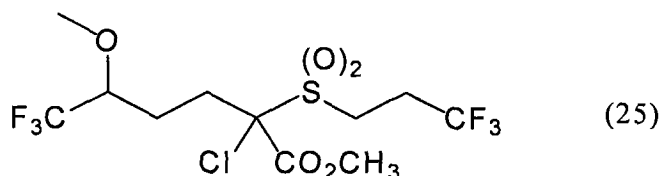
[0567] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 3.89 (s, 1.5H), 3.88 (s, 1.5H), 3.84–3.95 (m, 1H), 3.30–3.63 (m, 6H), 1.63–2.82 (m, 6H)。

[0568] 制备实施例 25

[0569] 在室温下,向 0.8g 本发明化合物 (24) 的 30ml 四氢呋喃溶液中加入 0.1g 氢化钠 (60% 的油溶液)。将反应混合物在同一温度下搅拌 0.5 小时。在室温下,向反应混合物中加入 0.3g N-氯代琥珀酰亚胺,然后搅拌 1 小时。向其中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 0.50g 2-氯-6,6,6-三氟-5-甲氧基-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)己酸甲酯(下文亦称本发明化合物 (25))。

[0570] 本发明化合物 (25) :

[0571]



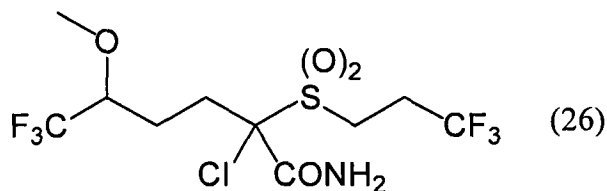
[0572] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 3.95 (s, 3H), 3.49–3.89 (m, 3H), 3.56 (s, 3H), 1.78–2.91 (m, 6H)。

[0573] 制备实施例 26

[0574] 在室温下,向 0.4g 本发明化合物 (25) 的 20ml 甲醇溶液中加入 0.4ml 氨 (7M 甲醇溶液),然后在同一温度下搅拌 2 天。减压浓缩反应混合物。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 0.28g 2-氯-6,6,6-三氟-5-甲氧基-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)己酰胺(下文亦称本发明化合物 (26))。

[0575] 本发明化合物 (26) :

[0576]



[0577] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 6.88 (bs, 1H), 5.98 (bs, 1H), 3.37–3.80 (m, 3H), 3.58 (s, 3H), 1.66–2.86 (m, 6H)。

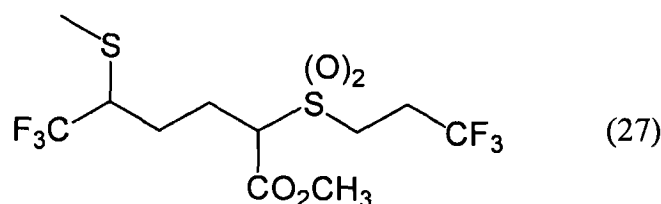
[0578] 制备实施例 27

[0579] 在室温下,向 5.0g 甲磺酸 4,4,4-三氟-3-甲硫基-丁酯和 4.6g (3,3,3-三氟丙基磺酰基)乙酸甲酯的 50ml 二甲亚砜溶液中加入 0.8g 氢化钠 (60% 的油溶液)。将反应混合物加热至 60℃,在同一温度下搅拌 5 天,然后使之静置冷却至室温附近。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁

干燥,然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 2.00g 6,6,6-三氟-5-甲硫基-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)己酸甲酯(下文亦称本发明化合物(27))。

[0580] 本发明化合物(27):

[0581]



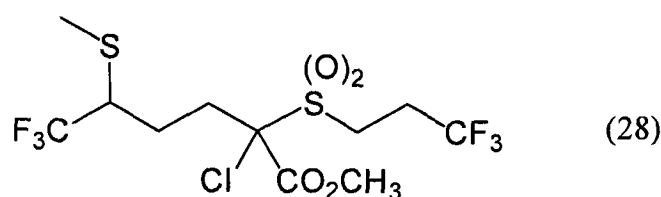
[0582] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS): δ (ppm) 3.89 (s, 3H), 3.81-3.93 (m, 1H), 3.30-3.52 (m, 2H), 2.13-3.00 (m, 5H), 2.23 (s, 1.5H), 2.22 (s, 1.5H), 1.58-2.08 (m, 2H)。

[0583] 制备实施例 28

[0584] 在室温下,向 1.0g 本发明化合物(27)的 30ml 四氢呋喃溶液中加入 0.1g 氢化钠(60%的油溶液)。将反应混合物在同一温度下搅拌 0.5 小时。在室温下,向反应混合物中加入 0.3g N-氯代琥珀酰亚胺,然后搅拌 2 小时。向其中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 0.80g 2-氯-6,6,6-三氟-5-甲硫基-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)己酸甲酯(下文亦称本发明化合物(28))。

[0585] 本发明化合物(28):

[0586]



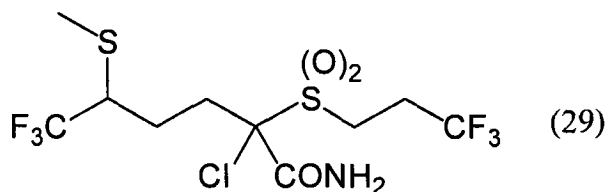
[0587] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS): δ (ppm) 3.97 (s, 1.5H), 3.96 (s, 1.5H), 3.50-3.85 (m, 2H), 1.70-3.10 (m, 7H), 2.23 (s, 1.5H), 2.22 (s, 1.5H)。

[0588] 制备实施例 29

[0589] 在室温下,向 0.7g 本发明化合物(28)的 20ml 甲醇溶液中加入 0.7ml 氨(7M 甲醇溶液),然后在同一温度下搅拌 16 小时。减压浓缩反应混合物。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 0.42g 2-氯-6,6,6-三氟-5-甲硫基-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)己酰胺(下文亦称本发明化合物(29))。

[0590] 本发明化合物(29):

[0591]



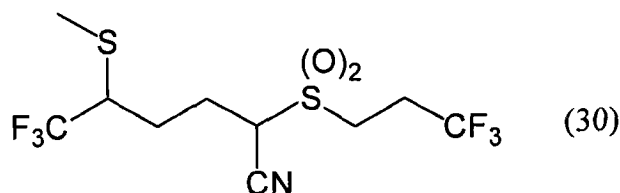
[0592] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS): δ (ppm) 6.87 (bs, 1H), 5.87 (bs, 1H), 3.38-3.78 (m, 2H), 2.22 (s, 3H), 1.50-3.08 (m, 7H)。

[0593] 制备实施例 30

[0594] 在室温下,向 1.0g 甲磺酸 4,4,4-三氟-3-甲硫基-丁酯和 0.8g(3,3,3-三氟丙基磺酰基)乙腈的 30ml 二甲亚砜溶液中加入 0.5g 碳酸钾,加热至 60℃,然后在同一温度下搅拌 2 天。使反应混合物静置冷却至室温附近。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 0.49g 6,6,6-三氟-5-甲硫基-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)己腈(下文亦称本发明化合物(30))。

[0595] 本发明化合物(30):

[0596]



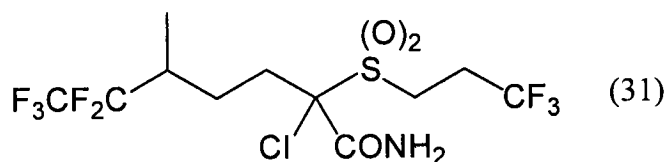
[0597] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS): δ (ppm) 3.99-4.13 (m, 1H), 3.40-3.64 (m, 2H), 1.66-3.64 (m, 10H)。

[0598] 制备实施例 31

[0599] 在室温下,向 2.0g 甲磺酸 4,4,5,5,5-五氟-3-甲基-戊酯和 1.7g(3,3,3-三氟丙基磺酰基)乙酸甲酯的 50ml 二甲亚砜溶液中加入 1.0g 碳酸钾,加热至 60℃,然后在同一温度下搅拌 7 天。使反应混合物静置冷却至室温附近。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 0.5g 6,6,7,7,7-五氟-5-甲基-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)庚酸甲酯,将其溶于 20ml 四氢呋喃。在室温下,向该溶液中加入 0.1g 氢化钠(60%的油溶液)。将反应混合物在同一温度下搅拌 0.5 小时。在室温下,向反应混合物中加入 0.2gN-氯代琥珀酰亚胺,然后搅拌 2 小时。向其中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。将所得残余物溶于 20ml 甲醇。在室温下,向该溶液中加入 0.5ml 氨(7M 甲醇溶液),然后在同一温度下搅拌 30 小时。减压浓缩反应混合物。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 0.22g 2-氯-6,6,7,7,7-五氟-5-甲基-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)庚酰胺(下文亦称本发明化合物(31))。

[0600] 本发明化合物(31):

[0601]

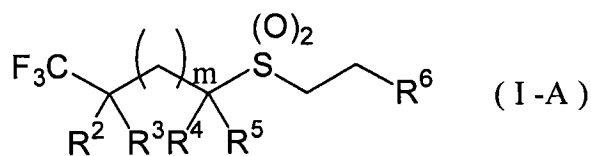


[0602] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS): δ (ppm) 6.97 (bs, 1H), 6.51 (bs, 1H), 3.35-3.80 (m, 2H), 1.35-2.83 (m, 7H), 1.19 (d, 3H)。

[0603] 接下来是本发明的化合物的具体实例。

[0604] 由式(I-A)表示的化合物:

[0605]



[0606] 其中 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 和 m 表示下表 1 至表 30 中所列的组合。

[0607] [表 1]

	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
	CH ₃	H	CN	H	CF ₃	2
	CH ₃	H	CN	H	CF ₂ CF ₃	2
	CH ₃	H	CN	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
	CH ₃	H	CN	F	CF ₃	2
	CH ₃	H	CN	F	CF ₂ CF ₃	2
	CH ₃	H	CN	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
	CH ₃	H	CN	Cl	CF ₃	2
	CH ₃	H	CN	Cl	CF ₂ CF ₃	2
	CH ₃	H	CN	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
	CH ₃	H	CN	CH ₃	CF ₃	2
	CH ₃	H	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
[0608]	CH ₃	H	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
	CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
	CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₃	2
	CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
	CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
	CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₃	2
	CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
	CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
	CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₃	2
	CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
	CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
	CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
	CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0609] [0607] [表 2]

[0610]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
CH ₃	H	CONH ₂	H	CF ₃	2
CH ₃	H	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	H	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	H	CONH ₂	F	CF ₃	2
CH ₃	H	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	H	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	H	CONH ₂	Cl	CF ₃	2
CH ₃	H	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	H	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₃	2
CH ₃	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	H	C(S)NH ₂	H	CF ₃	2
CH ₃	H	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	H	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	H	C(S)NH ₂	F	CF ₃	2
CH ₃	H	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	H	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₃	2
CH ₃	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₃	2
CH ₃	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0611] [0609] [表 3]

[0612]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
CH ₃	CH ₃	CN	H	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CN	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CN	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CN	F	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CN	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CN	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CN	Cl	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CN	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CN	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0613] [0611] [表 4]

[0614]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
CH ₃	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0615] [0613] [表 5]

[0616]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
CH ₂ CH ₃	H	CN	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CN	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CN	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CN	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CN	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CN	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CN	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CN	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CN	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CN	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0617] [0615] [表 6]

[0618]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0619] [0617] [表 7]

[0620]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0621] [0619] [表 8]

[0622]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0623] [0621] [表 9]

	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
[0624]	CH(CH ₃) ₂	H	CN	H	CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CN	H	CF ₂ CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CN	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CN	F	CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CN	F	CF ₂ CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CN	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CN	Cl	CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CN	Cl	CF ₂ CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CN	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CN	CH ₃	CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
	CH(CH ₃) ₂	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0625] [0623] [表 10]

[0626]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
CH(CH ₃) ₂	H	CONH ₂	H	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	CONH ₂	F	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	CONH ₂	Cl	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	C(S)NH ₂	H	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	C(S)NH ₂	F	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0627] [0625] [表 11]

[0628]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CN	H	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CN	H	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CN	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CN	F	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CN	F	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CN	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CN	Cl	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CN	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CN	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0629] [0627] [表 12]

[0630]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0631] [0629] [表 13]

[0632]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
C(CH ₃) ₃	H	CN	H	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CN	H	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CN	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CN	F	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CN	F	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CN	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CN	Cl	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CN	Cl	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CN	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CN	CH ₃	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0633] [0631] [表 14]

[0634]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
C(CH ₃) ₃	H	CONH ₂	H	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CONH ₂	F	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CONH ₂	Cl	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	C(S)NH ₂	H	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	C(S)NH ₂	F	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0635] [0633] [表 15]

[0636]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CN	H	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CN	H	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CN	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CN	F	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CN	F	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CN	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CN	Cl	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CN	Cl	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CN	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0637] [0635] [表 16]

[0638]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0639] [0637] [表 17]

[0640]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
OCH ₃	H	CN	H	CF ₃	2
OCH ₃	H	CN	H	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CN	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CN	F	CF ₃	2
OCH ₃	H	CN	F	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CN	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CN	Cl	CF ₃	2
OCH ₃	H	CN	Cl	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CN	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CN	CH ₃	CF ₃	2
OCH ₃	H	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
OCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
OCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
OCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
OCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0641] [0639] [表 18]

[0642]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
OCH ₃	H	CONH ₂	H	CF ₃	2
OCH ₃	H	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CONH ₂	F	CF ₃	2
OCH ₃	H	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CONH ₂	Cl	CF ₃	2
OCH ₃	H	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₃	2
OCH ₃	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	C(S)NH ₂	H	CF ₃	2
OCH ₃	H	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	C(S)NH ₂	F	CF ₃	2
OCH ₃	H	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₃	2
OCH ₃	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₃	2
OCH ₃	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0643] [0641] [表 19]

[0644]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
OCH ₃	CH ₃	CN	H	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CN	H	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CN	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CN	F	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CN	F	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CN	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CN	Cl	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CN	Cl	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CN	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0645] [0643] [表 20]

[0646]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
OCH ₃	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0647] [0645] [表 21]

[0648]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
SCH ₃	H	CN	H	CF ₃	2
SCH ₃	H	CN	H	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CN	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CN	F	CF ₃	2
SCH ₃	H	CN	F	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CN	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CN	Cl	CF ₃	2
SCH ₃	H	CN	Cl	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CN	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CN	CH ₃	CF ₃	2
SCH ₃	H	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
SCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
SCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
SCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
SCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0649] [0647] [表 22]

[0650]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
SCH ₃	H	CONH ₂	H	CF ₃	2
SCH ₃	H	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CONH ₂	F	CF ₃	2
SCH ₃	H	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CONH ₂	Cl	CF ₃	2
SCH ₃	H	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₃	2
SCH ₃	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	C(S)NH ₂	H	CF ₃	2
SCH ₃	H	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	C(S)NH ₂	F	CF ₃	2
SCH ₃	H	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₃	2
SCH ₃	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₃	2
SCH ₃	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0651] [0649] [表 23]

[0652]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
SCH ₃	CH ₃	CN	H	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CN	H	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CN	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CN	F	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CN	F	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CN	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CN	Cl	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CN	Cl	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CN	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0653] [0651] [表 24]

[0654]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
SCH ₃	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0655] [0653] [表 25]

[0656]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CN	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CN	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CN	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CN	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CN	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CN	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CN	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CN	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CN	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CN	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0657] [0655] [表 26]

[0658]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0659] [0657] [表 27]

[0660]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0661] [0659] [表 28]

[0662]

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(S)NH ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	2

[0663] [0661] [表 29]

[0664]

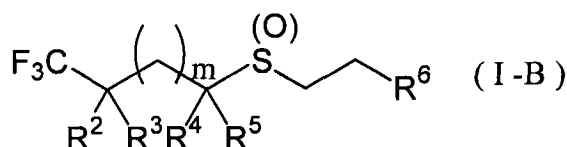
R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m
CH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
CH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
CH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
CH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
C(CH ₃) ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2

[0665] [0663] [表 30]

R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	m
OCH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
OCH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
OCH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
OCH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
OCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
SCH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
SCH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
SCH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
SCH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
SCH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	F	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	2
CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	2

[0667] 由式 (I-B) 表示的化合物:

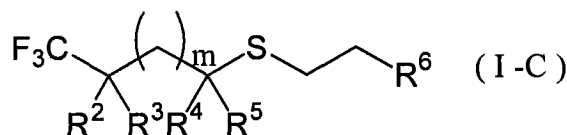
[0668]



[0669] 其中 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 和 m 表示上表 1 至表 3 中所列的组合。

[0670] 由式 (I-C) 表示的化合物：

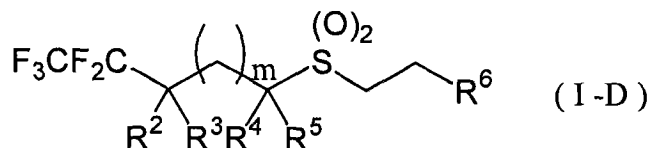
[0671]



[0672] 其中 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 和 m 表示上表 1 至表 30 中所列的组合。

[0673] 由式 (I-D) 表示的化合物：

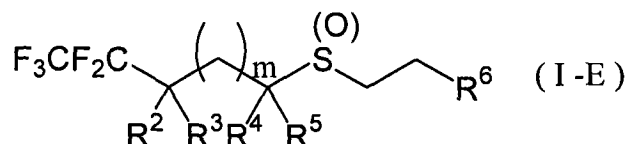
[0674]



[0675] 其中 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 和 m 表示下表 1 至表 30 中所列的组合。

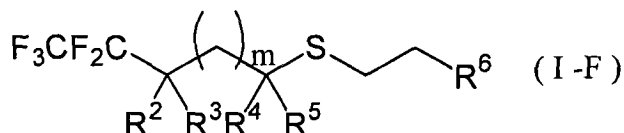
[0676] 由式 (I-E) 表示的化合物：

[0677]

[0678] 其中 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 和 m 表示上表 1 至表 30 中所列的组合。

[0679] 由式 (I-F) 表示的化合物：

[0680]

[0681] 其中 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 和 m 表示上表 1 至表 30 中所列的组合。

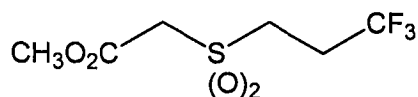
[0682] 接下来是作为参考制备实施例的用于制备本发明化合物的中间体的制备实施例。

[0683] 参考制备实施例 1

[0684] 在冰冷却下, 向 10g 硫乙酸甲酯和 21g 1-碘-3,3,3-三氟丙烷的 200ml N,N-二甲基甲酰胺溶液中加入 13g 碳酸钾, 然后在室温下搅拌 20 小时。向反应混合物中加入 10% 盐酸, 接着用乙酸乙酯萃取。有机层依次用 10% 盐酸和饱和氯化钠水溶液洗涤, 经无水硫酸镁干燥, 然后减压浓缩, 得到含有 (3,3,3-三氟丙硫基) 乙酸甲酯的粗产物。将所得粗产物溶于 100ml 冰醋酸后, 并在冰冷却下, 向所得溶液中加入 50ml 过乙酸 (32% (重量/重量) 乙酸溶液)。将混合物在 60℃ 下搅拌 16 小时。在反应中间, 通过 TLC (薄层色谱法) 分析证实推测是亚砷形式的化合物的形成。使反应混合物静置冷却至室温附近, 倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。有机层依次用饱和碳酸氢钠水溶液和饱和氯化钠水溶液洗涤, 经无水硫酸镁干燥, 然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理, 得到 14.1g (3,3,3-三氟丙基磺酰基) 乙酸甲酯。

[0685] (3,3,3-三氟丙基磺酰基) 乙酸甲酯：

[0686]



[0687] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 4.05 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.49-3.57 (m, 2H), 2.66-2.79 (m, 2H)。

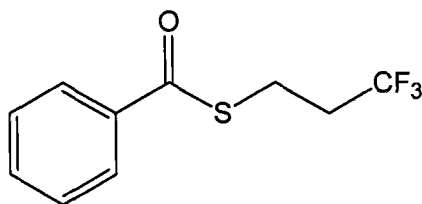
[0688] (3,3,3-三氟丙基磺酰基) 乙酸乙酯可以按照同样的方法获得, 只是使用硫乙酸乙酯替换硫乙酸甲酯。

[0689] 参考制备实施例 2

[0690] 在冰冷却下, 向 9.6g 1-溴-3,3,3-三氟丙烷和 5g 硫代苯甲酸的 30ml N,N-二甲基甲酰胺溶液中加入 1.45g 氢化钠 (60% 的油溶液), 然后在室温下搅拌 12 小时。向反应混合物中加入 10% 盐酸, 接着用乙酸乙酯萃取。有机层依次用 10% 盐酸和饱和氯化钠水溶液洗涤, 经无水硫酸镁干燥, 然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理, 得到 6.90g 硫代苯甲酸 S-(3,3,3-三氟丙基) 酯。

[0691] 硫代苯甲酸 S-(3,3,3-三氟丙基) 酯：

[0692]



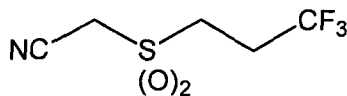
[0693] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 7.97 (d, 2H), 7.58–7.62 (m, 1H), 7.47 (dd, 2H), 3.24 (t, 2H), 2.44–2.56 (m, 2H)。

[0694] 参考制备实施例 3

[0695] 在冰冷却下,向 10g 硫代苯甲酸 S-(3,3,3-三氟丙基)酯的 50ml 四氢呋喃溶液中加入 8.4ml 甲醇钠 (28% (重量/重量) 甲醇溶液),然后在同一温度下,滴加 5.1g 溴乙腈。将混合物在室温下搅拌 2 小时。向反应混合物中加入 10% 盐酸,接着用乙酸乙酯萃取。有机层依次用 10% 盐酸和饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。将所得残余物溶于 40ml 冰醋酸,并在冰冷却下,向所得溶液中加入 20ml 过乙酸 (32% (重量/重量) 乙酸溶液)。将混合物在 60℃ 下搅拌 10 小时。使反应混合物静置冷却至室温附近,倒入水中,然后用乙酸乙酯萃取。有机层依次用饱和碳酸氢钠水溶液和饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。所得残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 7.04g (3,3,3-三氟丙基磺酰基)乙腈。

[0696] (3,3,3-三氟丙基磺酰基)乙腈:

[0697]



[0698] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 4.06 (s, 2H), 3.48–3.55 (m, 2H), 2.72–2.84 (m, 2H)。

[0699] 参考制备实施例 4

[0700] 步骤 1:

[0701] 在 -78℃ 冷却下,向由 18.4g 溴乙烷、4.3g 镁和 150ml 乙醚制备的乙基溴化镁的乙醚溶液中滴加 20g 三氟乙酸乙酯。将混合物在同一温度下搅拌 1 小时,然后升温至室温附近。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙醚萃取。有机层经无水硫酸镁干燥后过滤,得到 1,1,1-三氟-2-丁酮的乙醚溶液。

[0702] 步骤 2:

[0703] 在冰冷却下,向 5.6g 氢化钠 (60% 的油溶液) 的 500ml 四氢呋喃悬浮液中滴加 31.6g 二乙基膦酰基乙酸乙酯 (ethyldiethylphosphonoacetate)。在将混合物在同一温度下搅拌 10 分钟后,向其中滴加步骤 1 中所获得的 1,1,1-三氟-2-丁酮的乙醚溶液。将混合物在同一温度下搅拌 1 小时,然后升温至室温附近。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层经无水硫酸镁干燥然后减压浓缩,得到粗制的 3-三氟甲基-2-戊烯酸乙酯。

[0704] 步骤 3:

[0705] 在室温下,向在步骤 2 中获得的粗产物 3-三氟甲基-2-戊烯酸乙酯的 300ml 甲醇溶液中加入 2g 10% 钨碳。然后在常压下将氢气通入混合物中直到不再观察到氢吸收为止。反应完成后,该系统内部用氮气替换,减压过滤反应混合物。减压浓缩滤液,得到 3-(三氟甲基)戊酸甲酯和 3-(三氟甲基)戊酸乙酯的粗制混合物。

[0706] 步骤 4 :

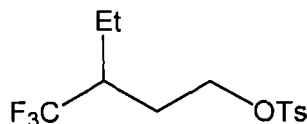
[0707] 在冰冷却下,向 5.3g 氢化铝锂的 300ml 乙醚悬浮液中滴加在步骤 3 中得到的粗制混合物的 50ml 乙醚溶液,然后在同一温度下搅拌 2 小时。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙醚萃取。有机层经无水硫酸镁干燥后过滤,得到 3-(三氟甲基)-1-戊醇的乙醚溶液。

[0708] 步骤 5 :

[0709] 将在步骤 4 中得到的 3-(三氟甲基)-1-戊醇的乙醚溶液和 26.8g 对甲苯磺酰氯溶于 300ml 四氢呋喃。在室温下,向该溶液中滴加 20ml 三乙胺,在同一温度下搅拌 4 天。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层依次用 10% 盐酸和饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。残余物用硅胶色谱法进行处理,得到 18.4g 对甲苯磺酸 3-三氟甲基-戊酯。

[0710] 对甲苯磺酸 3-三氟甲基-戊酯 :

[0711]



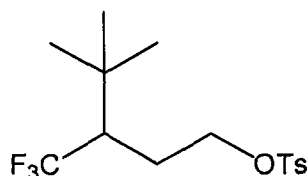
[0712] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 7.79 (d, 2H), 7.36 (d, 2H), 4.02-4.18 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 1.35-2.18 (m, 5H), 0.94 (t, 3H)。

[0713] 参考制备实施例 5

[0714] 按照参考制备实施例 4 制备对甲苯磺酸 4,4-二甲基-3-三氟甲基-戊酯,只是使用叔丁基锂替换乙基溴化镁。

[0715] 对甲苯磺酸 4,4-二甲基-3-三氟甲基-戊酯 :

[0716]



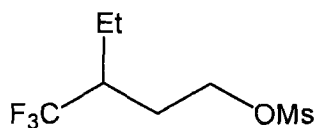
[0717] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 7.79 (d, 2H), 7.36 (d, 2H), 4.00-4.20 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 1.75-2.00 (m, 3H), 0.99 (s, 9H)。

[0718] 参考制备实施例 6

[0719] 按照参考制备实施例 4 得到甲磺酸 3-(三氟甲基)戊酯,只是使用甲磺酰氯替换对甲苯磺酰氯。

[0720] 甲磺酸 3-(三氟甲基)戊酯 :

[0721]



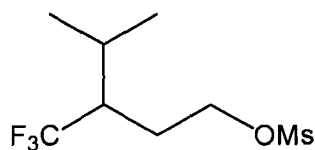
[0722] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 4.25-4.36 (m, 2H), 3.03 (s, 3H), 1.43-2.28 (m, 5H), 1.02 (dt, 3H)。

[0723] 参考制备实施例 7

[0724] 按照参考制备实施例 4 得到甲磺酸 4-甲基-3-(三氟甲基)戊酯,只是分别使用异丙基溴化镁和甲磺酰氯替换乙基溴化镁和对甲苯磺酰氯。

[0725] 甲磺酸 4-甲基-3-(三氟甲基)戊酯:

[0726]



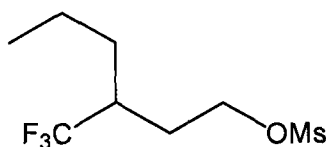
[0727] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS): δ (ppm) 4.19-4.40 (m, 2H), 3.03 (s, 3H), 1.85-2.25 (m, 4H), 1.00 (dd, 6H)。

[0728] 参考制备实施例 8

[0729] 按照参考制备实施例 4 得到甲磺酸 3-(三氟甲基)己酯,只是分别使用丙基溴化镁和甲磺酰氯替换乙基溴化镁和对甲苯磺酰氯。

[0730] 甲磺酸 3-(三氟甲基)己酯:

[0731]



[0732] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS): δ (ppm) 4.24-4.35 (m, 2H), 3.03 (s, 3H), 2.19-2.33 (m, 1H), 1.85-2.10 (m, 2H), 1.30-1.70 (m, 4H), 0.94 (t, 3H)。

[0733] 参考制备实施例 9

[0734] (步骤 1)

[0735] 在室温下,向 3g 4,4,4-三氟-2-丁烯酸乙酯的 30ml 甲醇溶液中滴加 5.3ml 甲醇钠(28%的甲醇溶液),然后在同一温度下搅拌 24 小时。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙醚萃取。有机层经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩,得到含有 4,4,4-三氟-3-甲氧基丁酸甲酯和 4,4,4-三氟-3-甲氧基丁酸乙酯的粗产物。

[0736] (步骤 2)

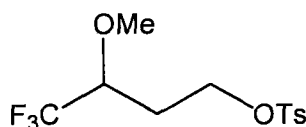
[0737] 在冰冷却下,向 0.7g 氢化铝锂的 30ml 乙醚悬浮液中滴加步骤 1 中得到的粗产物的 5ml 乙醚溶液。将混合物在同一温度下搅拌 1 小时。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙醚萃取。有机层经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩,得到粗制的 4,4,4-三氟-3-甲氧基-1-丁醇。

[0738] (步骤 3)

[0739] 将步骤 2 中得到的粗产物和 3.4g 对甲苯磺酰氯溶于 30ml 四氢呋喃。在室温下,向该溶液中滴加 2.5ml 三乙胺。将混合物在同一温度下搅拌 5 天。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层依次用 10% 盐酸和饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。残余物用硅胶柱色谱法进行处理,得到 4.20g 对甲苯磺酸 4,4,4-三氟-3-(甲氧基)丁酯。

[0740] 对甲苯磺酸 4,4,4-三氟-3-(甲氧基)丁酯:

[0741]



[0742] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 7.81 (dd, 2H), 7.37 (dd, 2H), 4.05–4.28 (m, 2H), 3.58–3.72 (m, 1H), 3.47 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 1.73–2.10 (m, 2H)。

[0743] 参考制备实施例 10

[0744] (步骤 1)

[0745] 在室温下,向 3g 4,4,4-三氟-2-丁烯酸乙酯的 30ml 甲醇溶液中加入 8.3g 甲硫醇钠 (15%水溶液),然后在同一温度下搅拌 2 天。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩,得到含有 4,4,4-三氟-3-甲硫基丁酸甲酯、4,4,4-三氟-3-甲硫基丁酸乙酯和 4,4,4-三氟-3-甲硫基丁酸的粗产物。

[0746] (步骤 2)

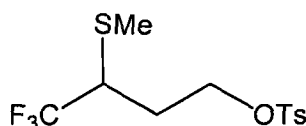
[0747] 在冰冷却下,向 0.7g 氢化铝锂的 30ml 乙醚悬浮液中,滴加步骤 1 中得到的粗产物的 5ml 乙醚溶液。将混合物在同一温度下搅拌 2 小时。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙醚萃取。有机层经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩,得到粗制的 4,4,4-三氟-3-甲硫基-1-丁醇。

[0748] (步骤 3)

[0749] 将步骤 2 中得到的粗产物和 3.3g 对甲苯磺酰氯溶于 30ml 四氢呋喃。在室温下,向该溶液中滴加 2.4ml 三乙胺。将混合物在同一温度下搅拌 3 天。向反应混合物中加入 10% 盐酸,然后用乙酸乙酯萃取。有机层依次用 10% 盐酸和饱和氯化钠水溶液洗涤,经无水硫酸镁干燥,然后减压浓缩。残余物用硅胶柱色谱法进行处理,得到 4.10g 对甲苯磺酸 4,4,4-三氟-3-(甲硫基)丁酯。

[0750] 对甲苯磺酸 4,4,4-三氟-3-(甲硫基)丁酯:

[0751]



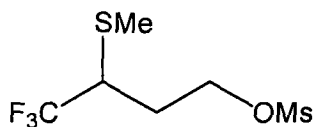
[0752] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 7.81 (dd, 2H), 7.37 (dd, 2H), 4.15–4.42 (m, 2H), 3.00–3.14 (m, 1H), 2.46 (s, 3H), 2.19–2.31 (m, 1H), 2.15 (s, 3H), 1.65–1.75 (m, 1H)。

[0753] 参考制备实施例 11

[0754] 按照参考制备实施例 10 得到甲磺酸 4,4,4-三氟-3-(甲硫基)丁酯,只是使用甲磺酰氯替换对甲苯磺酰氯。

[0755] 甲磺酸 4,4,4-三氟-3-(甲硫基)丁酯:

[0756]



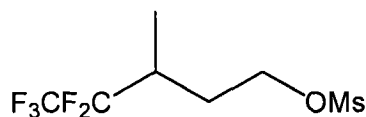
[0757] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) : δ (ppm) 4.35–4.61 (m, 2H), 3.11–3.24 (m, 1H), 3.06 (s, 3H), 2.31–2.45 (m, 1H), 2.25 (s, 3H), 1.78–1.90 (m, 1H)。

[0758] 参考制备实施例 12

[0759] 按照参考制备实施例 4 得到甲磺酸 4,4,5,5,5-五氟-3-甲基戊酯,只是分别使用五氟丙酸甲酯、甲基溴化镁和甲磺酰氯替换三氟乙酸乙酯、乙基溴化镁和对甲苯磺酰氯。

[0760] 甲磺酸 4,4,5,5,5-五氟-3-甲基戊酯:

[0761]



[0762] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS): δ (ppm) 4.26-4.40 (m, 2H), 3.04 (s, 3H), 2.18-2.55 (m, 2H), 1.68-1.79 (m, 1H), 1.19 (d, 3H)。

[0763] 接下来是制剂实施例。术语“份”是指重量份数。

[0764] 制剂实施例 1

[0765] 将 9 份本发明化合物 (1)-(31) 中的任一种溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚 (polyoxyethylene styryl phenyl ether) 和 6 份十二烷基苯磺酸钙后,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0766] 制剂实施例 2

[0767] 将 5 份本发明的化合物 (1) 和 4 份选自下列 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0768] [A] 组:

[0769] 磷化铝、特噻硫磷、硫线磷、氯氧磷、毒虫畏、毒死蜱、甲基毒死蜱、杀螟腈 (CYAP)、二嗪磷、DCIP (二氯二异丙醚)、除线磷 (ECP)、敌敌畏 (DDVP)、乐果、甲基毒虫畏、乙拌磷、EPN、乙硫磷、灭线磷、乙噻硫磷、倍硫磷 (MPP)、杀螟硫磷 (MEP)、噻唑磷、安硫磷、磷化氢、异柳磷、噁唑磷、马拉硫磷、甲亚砷磷、杀扑磷 (DMTP)、久效磷、二溴磷 (BRP)、异砷磷 (ESP)、对硫磷、伏杀硫磷、亚胺硫磷 (PMP)、甲基嘧啶磷、哒嗪硫磷、啗硫磷、稻丰散 (PAP)、丙溴磷、丙虫磷、丙硫磷、吡唑硫磷、蔬果磷、硫丙磷、丁基嘧啶磷、双硫磷、杀虫畏、特丁硫磷、甲基乙拌磷、敌百虫 (DEP)、蚜灭磷、甲拌磷、硫线磷;

[0770] 棉铃威、噁虫威、丙硫克百威、BPMC、甲萘威、克百威、丁硫克百威、除线威、乙硫苯威、仲丁威、苯硫威、苯氧威、呋线威、异丙威 (MIPC)、速灭威、灭多威、甲硫威、NAC、杀线威、抗蚜威、残杀威 (PHC)、XMC、硫双威、灭杀威、涕灭威;

[0771] 氟丙菊酯、烯丙菊酯、benfluthrin、 β -氟氯氰菊酯、联苯菊酯、乙氰菊酯、氟氯氰菊酯、氯氟氰菊酯、右旋烯炔菊酯、溴氰菊酯、S-氰戊菊酯、醚菊酯、氰戊菊酯、氟氰戊菊酯、三氟醚菊酯、氟氯苯菊酯、氟胺氰菊酯、苄呋菊酯、炔咪菊酯、右旋炔丙菊酯、除虫菊素、苄呋菊酯、 σ -氯氰菊酯、氟硅菊酯、七氟菊酯、四溴菊酯、四氟苯菊酯、胺菊酯、 λ -氯氟氰菊酯、 γ -氯氟氰菊酯、炔呋菊酯、 τ -氟胺氰菊酯、2,2-二甲基-3-(1-丙烯基)环丙烷甲酸 2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苄酯、2,2-二甲基-3-(2-甲基-1-丙烯基)环丙烷甲酸 2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苄酯、2,2,3,3-四甲基环丙烷甲酸 2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苄酯;

[0772] 杀螟丹、杀虫磺、杀虫环、杀虫单、杀虫双;

[0773] 吡虫啉、烯啶虫胺、啶虫脒、噻虫嗪、噻虫啉;

[0774] 氟啉脲、双二氟虫脲、丁醚脲、除虫脲、啉啉脲、氟环脲、氟虫脲、氟铃脲、虱螨脲、氟酰脲、多氟脲、氟苯脲、杀铃脲、triazuron；

[0775] 乙酰虫脒、氟虫脒、氟吡啉虫、pyriprole、pyrafluprole 等；

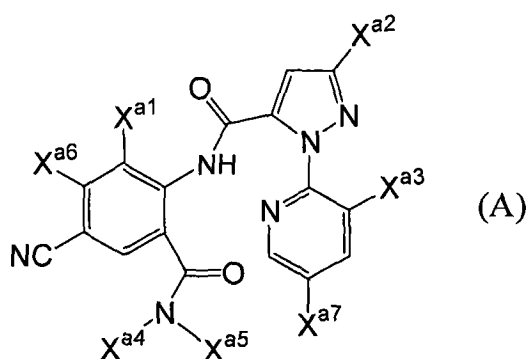
[0776] 环虫酰肼、氯虫酰肼、甲氧虫酰肼、虫酰肼；

[0777] 艾氏剂、狄氏剂、遍地克、硫丹、甲氧滴滴涕；

[0778] 硫酸烟碱；

[0779] 阿维菌素-B、溴螨酯、噻嗪酮、溴虫清、灭蝇胺、D-D(1,3-二氯丙烯)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐、啉啉醚、吡氟硫磷、烯虫乙酯、烯虫酯、茚虫威、噁虫酮、密比霉素-A(milbemycin-A)、吡蚜酮、啉虫醚、多杀菌素、氟虫胺、啉虫酰胺、啉蚜威、氟虫酰胺、lepimectin、砷酸、benclothiaz、氰氨化钙、石硫合剂、氯丹、DDT、DSP、flufenimer、氟啉虫酰胺、flurimfen、伐虫脒、安百亩、威百亩、溴甲烷、油酸钾、protrifenbute、spiromesifen、硫磺、氰氟虫脒、螺虫乙酯、pyrfluquinazone、氯虫苯甲酰胺、tralopyril、由下式 (A) 表示的化合物：

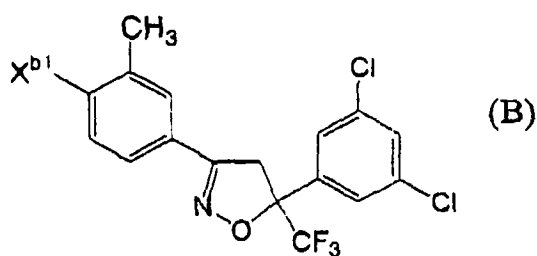
[0780]



[0781] 其中 X^{a1} 表示甲基、氯、溴或氟， X^{a2} 表示氟、氯、溴、C1-C4 卤代烷基或 C1-C4 卤代烷氧基， X^{a3} 表示氟、氯或溴， X^{a4} 表示任选取代的 C1-C4 烷基、任选取代的 C3-C4 烯基、任选取代的 C3-C4 炔基、任选取代的 C3-C5 环烷基或氢， X^{a5} 表示氢或甲基， X^{a6} 表示氢、氟或氯， X^{a7} 表示氢、氟或氯；

[0782] 由下式 (B) 表示的化合物：

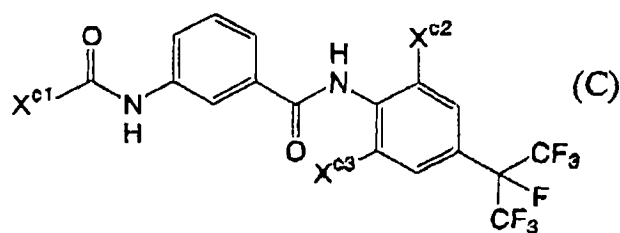
[0783]



[0784] 其中 X^{b1} 表示 X^{b2} -NH-C(=O)、 X^{b2} -C(=O)-NH、 X^{b3} -S(O)、任选取代的吡咯-1-基、任选取代的咪唑-1-基、任选取代的吡啶-1-基或任选取代的 1,2,4-三唑-1-基， X^{b2} 表示任选取代的 C1-C4 卤代烷基例如 2,2,2-三氟乙基或任选取代的 C3-C6 环烷基例如环丙基， X^{b3} 表示任选取代的 C1-C4 烷基例如甲基；

[0785] 由下式 (C) 表示的化合物：

[0786]



[0787] 其中 X^{c1} 表示任选取代的 C1-C4 烷基例如 3,3,3-三氟丙基、任选取代的 C1-C4 烷氧基例如 2,2,2-三氯乙氧基或任选取代苯基例如苯基, X^{c2} 表示甲基或三氟甲硫基, X^{c3} 表示甲基或卤素;

[0788] 灭螨醌、双甲脒、苯螨特、联苯肼酯、溴螨酯、灭螨猛、乙酯杀螨醇、CPCBS(杀螨酯)、四螨嗪、cyflumetofen、三氯杀螨醇(kelthane/dicofol)、苯丁锡、苯硫威、唑螨酯、啞螨酯、fluproxyfen、噻螨酮、炔螨特(BPPS)、哒螨灵、啞螨醚、吡螨胺、三氯杀螨砒、螺螨酯、spiromesifen、螺虫乙酯、amidoflumet 和 cyenopyrafen。

[0789] 制剂实施例 3

[0790] 将 5 份本发明的化合物 (2) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0791] 制剂实施例 4

[0792] 将 5 份本发明的化合物 (3) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0793] 制剂实施例 5

[0794] 将 5 份本发明的化合物 (4) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0795] 制剂实施例 6

[0796] 将 5 份本发明的化合物 (5) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0797] 制剂实施例 7

[0798] 将 5 份本发明的化合物 (6) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0799] 制剂实施例 8

[0800] 将 5 份本发明的化合物 (7) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0801] 制剂实施例 9

[0802] 将 5 份本发明的化合物 (8) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺

酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0803] 制剂实施例 10

[0804] 将 5 份本发明的化合物 (9) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0805] 制剂实施例 11

[0806] 将 5 份本发明的化合物 (10) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0807] 制剂实施例 12

[0808] 将 5 份本发明的化合物 (11) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0809] 制剂实施例 13

[0810] 将 5 份本发明的化合物 (12) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0811] 制剂实施例 14

[0812] 将 5 份本发明的化合物 (13) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0813] 制剂实施例 15

[0814] 将 5 份本发明的化合物 (14) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0815] 制剂实施例 16

[0816] 将 5 份本发明的化合物 (15) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0817] 制剂实施例 17

[0818] 将 5 份本发明的化合物 (16) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0819] 制剂实施例 18

[0820] 将 5 份本发明的化合物 (17) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0821] 制剂实施例 19

[0822] 将 5 份本发明的化合物 (18) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和

37.5 份 N, N- 二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙烯基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0823] 制剂实施例 20

[0824] 将 5 份本发明的化合物 (19) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N, N- 二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙烯基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0825] 制剂实施例 21

[0826] 将 5 份本发明的化合物 (20) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N, N- 二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙烯基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0827] 制剂实施例 22

[0828] 将 5 份本发明的化合物 (21) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N, N- 二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙烯基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0829] 制剂实施例 23

[0830] 将 5 份本发明的化合物 (22) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N, N- 二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙烯基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0831] 制剂实施例 24

[0832] 将 5 份本发明的化合物 (23) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N, N- 二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙烯基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0833] 制剂实施例 25

[0834] 将 5 份本发明的化合物 (24) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N, N- 二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙烯基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0835] 制剂实施例 26

[0836] 将 5 份本发明的化合物 (25) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N, N- 二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙烯基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0837] 制剂实施例 27

[0838] 将 5 份本发明的化合物 (26) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N, N- 二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙烯基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0839] 制剂实施例 28

[0840] 将 5 份本发明的化合物 (27) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N, N- 二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙烯基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙,充分搅拌混匀,得到乳剂。

[0841] 制剂实施例 29

[0842] 将 5 份本发明的化合物 (28) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N, N- 二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙, 充分搅拌混匀, 得到乳剂。

[0843] 制剂实施例 30

[0844] 将 5 份本发明的化合物 (29) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N, N- 二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙, 充分搅拌混匀, 得到乳剂。

[0845] 制剂实施例 31

[0846] 将 5 份本发明的化合物 (30) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N, N- 二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙, 充分搅拌混匀, 得到乳剂。

[0847] 制剂实施例 32

[0848] 将 5 份本发明的化合物 (31) 和 4 份选自 [A] 组的化合物溶于 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N, N- 二甲基甲酰胺中。向其中加入 10 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚和 6 份十二烷基苯磺酸钙, 充分搅拌混匀, 得到乳剂。

[0849] 制剂实施例 33

[0850] 将 5 份 SORPOL 5060 (TOHO Chemical Industry Co., LTD. 的注册商标名) 加到 40 份本发明化合物 (1)-(31) 中的任一种中, 并充分混匀。然后, 向所得混合物中加入 32 份 CARPLEX#80 (Shionogi&Co., Ltd. 的注册商标名, 合成的无水氧化硅细粉) 和 23 份 300 目硅藻土, 用果汁搅拌机混匀, 得到可湿性粉剂。

[0851] 制剂实施例 34

[0852] 将 3 份本发明化合物 (1)-(31) 中的任一种、5 份合成的含水氧化硅 细粉、5 份十二烷基苯磺酸钠、30 份皂土和 57 份粘土进行搅拌充分混匀。向此混合物中加入适量的水。将混合物进一步搅拌, 用制粒机制粒, 然后风干, 得到颗粒剂。

[0853] 制剂实施例 35

[0854] 将 4.5 份本发明化合物 (1)-(31) 中的任一种、1 份合成的含水氧化硅细粉、1 份 Dorires B (由 Sankyo 公司制造) 作为絮凝剂和 7 份粘土用研钵充分混匀, 然后用果汁搅拌机搅拌。向所得混合物中加入 86.5 份切断粘土 (cut clay), 充分搅拌混匀, 得到粉剂。

[0855] 制剂实施例 36

[0856] 将 10 份本发明化合物 (1)-(31) 中的任一种、35 份含有 50 份聚氧乙烯烷基醚硫酸铵盐的白炭和 55 份水混合, 然后用湿磨法碾磨得非常细, 得到制剂。

[0857] 制剂实施例 37

[0858] 将 0.5 份本发明化合物 (1)-(31) 中的任一种溶于 10 份二氯甲烷。将该溶液与 89.5 份 Isopar M (异构烷烃 (isoparaffin) : Exxon Chemical 的注册商标名) 混匀, 得到油制剂。

[0859] 制剂实施例 38

[0860] 将 0.1 份本发明化合物 (1)-(31) 中的任一种和 49.9 份 NEO-THIOZOL (Chuo Kasei Co., Ltd.) 放入气溶胶储罐中。给储罐装上气雾剂阀门, 然后向储罐中充入 25 份二甲醚和 25 份 LPG。给储罐装上调速控制器, 得到油性气雾剂。

[0861] 制剂实施例 39

[0862] 向气雾剂容器中装入 0.6 份本发明化合物 (1)-(31) 中的任一种、0.01 份 BHT、5 份二甲苯、0.39 份脱臭煤油和 1 份乳化剂 [Atmos 300 (Atmos Chemical Ltd. 的注册商标名)] 的混合物和 50 份蒸馏水。将阀门部件与容器连接, 然后在高压下通过阀门向容器中灌入 40 份抛射剂 (LPG), 得到含水气溶胶。

[0863] 制剂实施例 40

[0864] 将 5 份本发明化合物 (1)-(31) 中的任一种溶于 80 份二甘醇一乙醚。向其中加入 15 份碳酸亚丙酯后混匀, 得到点施液体制剂 (spot-on liquid formulation)。

[0865] 制剂实施例 41

[0866] 将 10 份本发明化合物 (1)-(31) 中的任一种溶于 70 份二甘醇一乙醚。向其中加入 20 份 2-辛基十二烷醇后混匀, 得到泼淋液体制剂 (pour-on liquid formulation)。

[0867] 制剂实施例 42

[0868] 向 0.5 份本发明化合物 (1)-(31) 中的任一种中加入 60 份 NIKKOLTEALS-42 (42% 三乙醇胺十二烷基硫酸盐的水溶液, Nikko Chemicals) 和 20 份丙二醇。充分搅拌混合物, 得到均匀溶液。向其中加入 19.5 份水, 充分搅拌混匀, 得到均质香波制剂。

[0869] 制剂实施例 43

[0870] 多孔陶瓷板 (长 4.0cm, 宽 0.4cm, 厚度 1.2cm) 用 0.1g 本发明化合物 (1)-(31) 中任一种的 2ml 丙二醇溶液浸透, 得到加热型发烟剂。

[0871] 制剂实施例 44

[0872] 在密封的压力捏和机 (Moriyama Manufacturing Co., Ltd.) 中, 将 5 份本发明化合物 (1)-(31) 中的任一种和 95 份乙烯-甲基丙烯酸甲酯共聚物 (共聚物中甲基丙烯酸甲酯的比例为 10% (重量), ACRYFT WD301, Sumitomo Chemical) 融化并捏和。所得捏和产物用压出机通过模压成型模子压出, 得到长为 15cm、直径为 3mm 的棒状模制品。

[0873] 制剂实施例 45

[0874] 在密封的压力捏和机 (Moriyama Manufacturing Co., Ltd.) 中, 将 5 份本发明化合物 (1)-(31) 中的任一种和 95 份挠性聚氯乙烯树脂融化并捏和。所得捏和产物用压出机通过模压成型模子压出, 得到长为 15cm、直径为 3mm 的棒状模制品。

[0875] 接下来将通过试验实施例对作为杀虫组合物活性成分的本发明化合物的功效进行阐述。

[0876] 实验实施例 1

[0877] 将按照制剂实施例 36 得到的本发明化合物 (2)、(3)、(5)、(6)、(8)、(9)、(10)、(11)、(12)、(14)、(15)、(16)、(17)、(19)、(20)、(23)、(24)、(25)、(26)、(28)、(29) 和 (31) 的制剂进行稀释, 使得活性成分的浓度为 55.6ppm, 得到试验溶液。

[0878] 同时, 将 50g 栽培土 Bonsol No. 2 (由 Sumitomo Chemical Co., Ltd. 制造) 装入聚乙烯杯中, 杯底有 5 个直径为 5mm 的小孔, 将 10-15 粒稻种播在栽培土中。水稻植株生长直到发出第二营养叶, 然后使植物从杯底吸收试验溶液, 由此用 45ml 试验溶液进行处理。将水稻植株置于 25℃ 温室中达 6 天, 然后割成 5cm 的相同高度。将 31 只褐稻虱 (*Nilaparvata lugens*) 龄期幼虫放到 25℃ 温室中, 停留 6 天。然后, 检查在水稻植株上寄生的褐稻虱的数目。

[0879] 结果,在用本发明化合物 (2)、(3)、(5)、(6)、(8)、(9)、(10)、(11)、(12)、(14)、(15)、(16)、(17)、(19)、(20)、(23)、(24)、(25)、(26)、(28)、(29) 和 (31) 处理过的植物上,寄生性害虫的数量在 3 只以内。

[0880] 实验实施例 2

[0881] 将按照制剂实施例 36 得到的本发明化合物 (2)、(3)、(5)、(6)、(9)、(10)、(11)、(12)、(13)、(14)、(15)、(16)、(17)、(19)、(20)、(24)、(25)、(26)、(28)、(29)、(30) 和 (31) 的制剂进行稀释,使得活性成分的浓度为 500ppm,得到试验溶液。

[0882] 将直径为 5.5cm 的滤纸铺在直径为 5.5cm 的聚乙烯杯底,将 0.7ml 试验溶液滴加到滤纸上。将作为诱饵的 30mg 蔗糖均匀地撒在滤纸上。将 10 只家蝇 (*Musca domestica*) 雌性成虫放到聚乙烯杯中,用盖将杯封住。24 小时后,检查存活的家蝇数目,计算出害虫的死亡率。

[0883] 结果,用本发明化合物 (2)、(3)、(5)、(6)、(9)、(10)、(11)、(12)、(13)、(14)、(15)、(16)、(17)、(19)、(20)、(24)、(25)、(26)、(28)、(29)、(30) 和 (31) 处理时,害虫死亡率为 70% 以上。

[0884] 实验实施例 3

[0885] 将按照制剂实施例 36 得到的本发明化合物 (2)、(3)、(5)、(6)、(10)、(11)、(12)、(14)、(15)、(16)、(17)、(19)、(20)、(24)、(25)、(26)、(29)、(30) 和 (31) 的制剂进行稀释,使得活性成分的浓度为 500ppm,得到试验溶液。

[0886] 将直径为 5.5cm 的滤纸铺在直径为 5.5cm 的聚乙烯杯底,将 0.7ml 试验溶液滴加到滤纸上。将作为诱饵的 30mg 蔗糖均匀地撒在滤纸上。将 2 只德国小蠊 (*Blattella germanica*) 雄性成虫放到聚乙烯杯中,用盖将杯封住。6 天后,检查存活的德国小蠊数目,计算出害虫的死亡率。

[0887] 结果,在用本发明化合物 (2)、(3)、(5)、(6)、(10)、(11)、(12)、(14)、(15)、(16)、(17)、(19)、(20)、(24)、(25)、(26)、(29)、(30) 和 (31) 处理时,害虫死亡率为 100%。

[0888] 实验实施例 4

[0889] 将按照制剂实施例 36 得到的本发明化合物 (1)、(2)、(3)、(4)、(5)、(6)、(9)、(10)、(11)、(12)、(14)、(15)、(16)、(17)、(19)、(20)、(22)、(23)、(24)、(26)、(27)、(28)、(29)、(30) 和 (31) 的制剂进行稀释,使得活性成分的浓度为 500ppm,得到试验溶液。

[0890] 向 100ml 离子交换水中加入 0.7ml 试验溶液 (活性成分的浓度为 3.5ppm)。将 20 只淡色库蚊 (*Culex pipiens pallens*) 末龄期幼虫放入该溶液中。一天后,检查存活的淡色库蚊数目,计算出害虫的死亡率。

[0891] 结果,在用本发明化合物 (1)、(2)、(3)、(4)、(5)、(6)、(9)、(10)、(11)、(12)、(14)、(15)、(16)、(17)、(19)、(20)、(22)、(23)、(24)、(26)、(27)、(28)、(29)、(30) 和 (31) 处理时,害虫死亡率为 90% 以上。

[0892] 实验实施例 5

[0893] 将 5 毫克本发明化合物 (3)、(10)、(14)、(15)、(16) 和 (17) 中的任一种溶于 10ml 丙酮。将 1 毫升丙酮溶液均匀地施加在滤纸 (TOYONo. 2; 5x10cm) 的一侧,使得滤纸以 100mg 本发明化合物 /m² 进行处理。干燥后,将滤纸对折,剪掉边缘以做成一个小袋。将不吸血的若虫期蜱 (长角血蜱 (*Haemaphysalis longicornis*), 10 只蜱 / 组) 放入袋中,袋子用夹

子夹住封口。2 天后,检查存活的蜚的数目,计算出死亡率。

[0894] 结果,在用本发明化合物 (3)、(10)、(14)、(15)、(16) 和 (17) 处理时,蜚的死亡率为 90%。

[0895] 工业实用性

[0896] 本发明的化合物对有害节肢动物具有优良的防治效果,因此,可用作杀虫组合物的活性成分。