[19]中华人民共和国国家知识产权局

[51]Int.Cl[6]
C07D239/52
A01N 43/54

[12]发明专利说明书

[21] ZL 专利号 93103485.X

[45]授权公告日 1999 年 3 月 31 日

[11]授权公告号 CN 1042729C

[22]申请日 93.3.3 [24]颁证日 98.12.25

[21]申请号 93103485.X

[30]优先权

[32]92.3.3 [33]JP [31]80264/92

[73]专利权人 久美蓝化学工业株式会社

地址 日本东京都

共同专利权人 井原化学工业株式会社

[72]发明人 漆畑育已 吉村巧 出口武司
米仓范久 境润悦 林 茂

[56]参考文献

EP353640	1990.2.7	C07D239/52
EP444286	1991.9.4	C07D239/28

审查员 E4 12

[74]专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

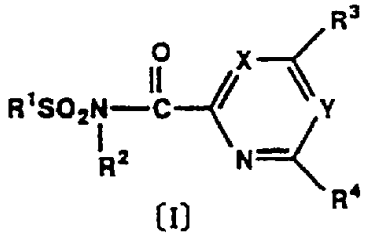
代理人 杨丽琴

权利要求书 8 页 说明书 43 页 附图页数 0 页

[54]发明名称 N－磺酰基含氮 6 员芳环羧酸酰胺衍生物和杀虫除草剂

[57]摘要

提供了由新颖的通式(Ⅰ)表示的 N－磺酰基含氮 6 员芳香环羟酸酰胺衍生物 及其盐以及含有它们作为有效成分的有害生物防除剂(式中,R^1表示烷基 或链烯基等,R^2表示氢原子或烷基等,R^3和 R^4可以相同或不同，表示烷基或烷氧基等,X 和 Y 可以相同或不同,表示次甲基或氮原子)。本 发明的 N－磺酰基含氮 6 员芳香环羟酸酰胺衍生物能以低浓度对由于藻菌纲类 的植物病原菌而引起的病害,特别是对霜霉病、芋疫病更能显示出优良的效果 ,并且可以防除水田和旱田中长出的各种杂草。

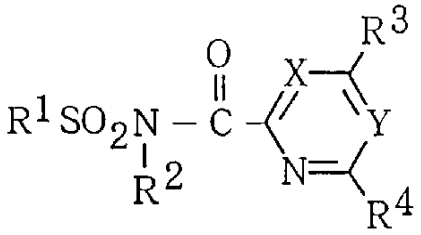


〔Ⅰ〕

ISSN1008-4274

权 利 要 求 书

1.由下面通式所表示的 N-磺酰基含氮 6 员芳香环羧酸酰胺衍生物或其盐



式中，

R^1表示

(a)碳原子数 1－10 的烷基

所述烷基可由以下基以 1 个或 1 个以上取代:

卤原子、

C_{3-8}的环烷基、

式 R^7O－基

式中 R^7表示氢原子、C_{1-10}的烷基、C_{2-8}的链烯基、C_{2-8}的炔基、苯基，所述苯基可用卤原子、C_{1-10}的烷基、C_{1-6}的烷氧基、C_{1-10}的卤代烷基、C_{1-6}的烷氧羰基，以一个或一个以上取代、

式 $R^7S(O)_n$-基，式中 R^7含义同前，n 表示 0－2 的整数、

式 $\begin{matrix}R^7\\R^8\end{matrix}>N$－基

式中 R^7含义同前、

R^8可用以下基以一个或一个以上取代:

C_{1-10}烷基、C_{2-8}链烯基、C_{2-8}炔基、C_{1-6}烷氧基、C_{2-8}链烯氧基、C_{2-8}炔氧基、或苯基，所述苯基可由卤原子、C_{1-10}烷基、C_{1-6}烷氧基、C_{1-10}卤代烷基、C_{1-6}烷氧羰基以一个或一个以上取

代、

三甲基甲硅烷基、

氰基、

环氧乙烷基、

式 R^8-CO-基，式中 R^8 含义同前、或者是

式 R^8-C(=NOR9)-基，式中 R^8 含义同前、R^9 表示 C_{1-10} 烷基、C_{2-8} 链烯基、C_{2-8} 炔基;

(b)C_{2-8} 链烯基

所述链烯基可由以下基以一个或一个以上取代:

卤原子、

苯基，所述苯基可由卤原子、C_{1-10} 烷基、C_{1-6} 烷氧基、C_{1-10} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧羰基，以一个或一个以上取代、

式 R^7O-基，式中 R^7 含义同前、

式 $R^7S(O)_n$- 基，式中 R^7 和 n 的含义同前、

式 R^7R^8N- 基，式中 R^7 和 R^8 含义同前、

三甲基甲硅烷基、

氰基、

式 R^8CO-基，式中 R^8 含义同前、或者是

式 R^8-C(=NOR^9)-基，式中 R^8 和 R^9 含义同前;

(c)C_{2-8} 炔基;

(d)C_{3-8} 环烷基

所述环烷基可由以下基以一个或一个以上取代:

卤原子、

C_{1-10} 烷基、

苯基，所述苯基可由卤原子、C_{1-10}烷基、C_{1-6}烷氧基、C_{1-10}卤代烷基、C_{1-6}烷氧羰基以一个或一个以上取代、

式R^7O-基，式中R^7含义同前、

式$R^7S(O)_n$-基，式中R^7和n含义同前、

式$\begin{matrix}R^7\\R^8\end{matrix}\!\!>N-$基，式中$R^7$和$R^8$含义同前、

三甲基甲硅烷基、

氰基、

氧、

式$R^9ON=$基，式中R^9含义同前、

式R^8CO-基，式中R^8含义同前、或者是

式R^8-$\underset{\underset{NOR^9}{\|}}{C}$-基，式中$R^8$和$R^9$含义同前；

(e)C_{3-8}环链烯基

所述环链烯基可由以下基以一个或一个以上取代：

卤原子、

C_{1-10}烷基、

苯基，所述苯该基可由卤原子、C_{1-10}烷基、C_{1-6}烷氧基、C_{1-10}卤代烷基、C_{1-6}烷氧羰基以一个或一个以上取代、

式中R^7O-基，式中R_7含义同前、

式中$R^7S(O)_n$-基，式中R-和n含义同前、

式$\begin{matrix}R^7\\R^8\end{matrix}\!\!>N-$基，式中$R^7$和$R^8$含义同前、

三甲基硅烷基、

氰基、

氧、

式$R^9ON=$基，式中R^9含义同前、

式R^8CO-基，式中R^8含义同前、或者是

式 R^8-C(=NOR^9)基，式中 R^8 和 R^9 含义同前；

(f)式 $\begin{matrix}R^5\\R^6\end{matrix}>N-$ 基

式中 R^5 表示以下的基团：

(i)C_{1-10} 烷基

所述烷基可由以下基团以一个或一个以上取代

卤原子、

C_{3-8} 环烷基、

式 R^7O-基，式中 R^7 含义同前、

式 $R^7S(O)_n$-基，式中 R^7 和 n 含义同前、

式 $\begin{matrix}R^7\\R^8\end{matrix}>N-$ 基，式中 R^7 和 R^8 含义同前、

三甲基硅烷基、

氰基、

环氧乙烷基、

式 R^8CO-基，式中 R^8 含义同前、或者是

式 R^8-C(=NOR^9)-基，式中 R^8 和 R^9 含义同前、

(ii)C_{2-8} 链烯基

所述链烯基可用以下基以一个或一个以上取代：

卤原子

苯基，所述苯基可用卤原子、C_{1-10} 烷基、C_{1-6} 烷氧基、C_{1-10} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧羰基以一个或一个以上取代、

C_{3-8} 环烷基、

式 R^7O-基，式中 R^7 含义同前、

式 $R^7S(O)_n$-基，式中 R^7 和 n 含义同前、

式 $\begin{matrix}R^7\\R^8\end{matrix}>N-$ 基，式中 R^7 和 R^8 含义同前、

三甲基甲硅烷基、

氰基、

式 R^8CO- 基，式中 R^8 含义同前、或者是

式 $R^8-C(=NOR^9)-$ 基，式中 R^8 和 R^9 含义同前、

(iii)C_{2-8} 炔基、

(iv)C_{3-8} 环烷基

所述环烷基可由以下基以一个或一个以上取代:

卤原子、

C_{1-10} 烷基、

苯基，所述苯基可由卤原、C_{1-10} 烷基、C_{1-6} 烷氧基、C_{1-10} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧羰基以一个或一个以上取代，

式 R^7O- 基，式中 R^7 含义同前、

式 $R^7S(O)_n-$ 基、式中 R^7 和 n 含义同前、

式 R^7R^8N- 基，式中 R^7 和 R^8 含义同前、

三甲基甲硅烷基、

氰基、

氧、

式 $R^9ON=$ 基，式中 R^9 含义同前、

式 R^8CO- 基，式中 R^8 含义同前、或者是

式 $R^8-C(=NOR^9)-$ 基，式中 R^8 和 R^9 含义同前，

(V)C_{3-8} 环链烯基

所述环链烯基可由以下基以一个或一个以上取代:

卤原子、

C_{1-10} 烷基、

苯基，所述苯基可由卤原子、C_{1-10}烷基、C_{1-6}烷氧基、C_{1-10}卤代烷基、C_{1-6}烷氧羰基以一个或一个以上取代、

式R^7O-基，式中R^7含义同前、

式$R^7S(O)_n$基，式中R^7和n含义同前、

式$\begin{matrix}R^7\\R^8\end{matrix}\!\!>\!N-$基，式中$R^7$和$R^8$含义同前、

三甲基甲硅烷基、

氰基、

氧、

式$R^9ON=$基，式中R^9含义同前、

式R^8CO-基，式中R^8含义同前、或者是

式R^8-C-基，式中R^8和R^9含义同前，

$\overset{\overset{\|}{N}OR^9}{}$

(vi)式R^7O-基，式中R^7含义同前，

R^6表示氢原子或R^5，

R^6和R^6可互相独立，R^5、R^6也可以与氮原子结合形成3-8员环，

(g)式 $R^{10}-\overset{\overset{O}{\|}}{C}-\overset{\overset{R^6}{|}}{N}$ 基

式中R^6含义同前，

R^{10}为

(i)C_{1-10}烷基

所述烷基可由以下基以一个或一个以上取代：

卤原子、

式R^7O-基，式中R^7含义同前、

式$R^7S(O)n$-基，式中R^7和n含义同前、

式$\begin{matrix}R^7\\R^8\end{matrix}\!\!>\!N-$基，式中$R^7$和$R^8$含义同前、或者是

氰基、

(ii)C_{2-8}链烯基

所述链烯基可由以下基以一个或一个以上取代:

卤原子、

式R^7O-基，式中R^7含义同前、

式$R^7S(O)_n$-基，式中R^7和n含义同前、

式$\begin{matrix}R^7\\R^8\end{matrix}>N-$基，式中$R^7$和$R^8$含义同前、或者是

氰基、

(iii)苯基

所述苯基可由以下基以一个或一个以上取代

卤原子、

C_{1-10}烷基、

C_{1-6}烷氧基、

C_{1-10}卤代烷基、

C_{1-6}烷氧羰基;

(h)式$R^{10}SO_2N(R^6)$－基，式中R^6和R^{10}含义同前

R^2表示氢原子或C_{1-10}烷基，该基可由C_{1-6}烷氧基或C_{1-6}烷氧羰基取代,、苄基或C_{2-8}链烯基;

R^3和R^4可以相同或不同，表示氢原子、卤原子、C_{1-10}烷基、

式R^7O-基，式中R^7含义同前、

式$R^7S(O)_n$-基，式中R^7和n含义同前、

式$\begin{matrix}R^7\\R^8\end{matrix}>N-$基，式中$R^7$和$R^8$含义同前、

C_{1-10}卤代烷基或

C_{1-6}卤代烷氧基、

X和Y可以相同或不同，表示次甲基或氮原子，但X和Y不能同时是次甲基。

2.含有权利要求 1 所述的 N-磺酰基含氮 6 员芳香环羧酸酰胺衍生物或其盐作为有效成分的有害生物防除剂。

说　　明　　书

N-磺酰基含氮6员芳环羧酸酰胺衍生物和杀虫除草剂

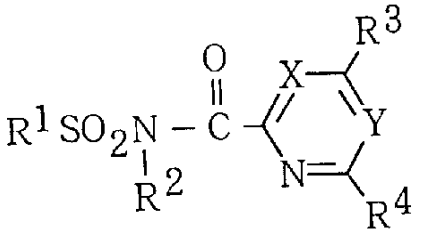
本发明是关于N－磺酰基含氮6员芳香环羧酸酰胺衍生物及其盐以及含有它们作为有效成分的有害生物防除剂。

作为含有化学结构上与本发明化合物相类似的化合物的现有技术，已知有特开平2－282371号专利公报说明书。由该文献中知道，这一现有技术具有除草剂和植物生长调节剂的效果。

在农业生产上，由于藻菌纲类的植物病原菌而引起的病害如霜霉病、芋疫病等，在许多农作物上都有发生，成为难以防治的病害之一，迫切地需要研制出有效的防除药剂。

本发明人合成了多种N－磺酰基含氮6员芳香环羧酸酰胺衍生物，对它们的生理活性反复进行了研究，结果发现N－磺酰基含氮6员芳香环羧酸酰胺衍生物的化合物组显示了良好的杀菌活性，从而完成了本发明。本发明的有害生物防除剂有效成分化合物是文献中没有记载的新化合物，以较低的浓度使用即可防除水田和旱田中产生的各种杂草。

本发明是含有以通式(I)表示的N－磺酰基含氮6员芳香环羧酸酰胺衍生物或其盐作为有效成分的有害生物防除剂



式中，

R^1表示

(a)烷基

所述烷基可由以下的基团以一个或一个以上取代:

卤原子、

环烷基、

式R^7-基

其中R^7表示氢原子、烷基、链烯基、炔基、苯基(该基可由卤原子、烷基、烷氧基、卤代烷基、烷氧羰基以一个或一个以上取代)、

式$R^7S(O)_n$基(其中R^7的含义同上,n是0-2的整数)、

式$\begin{matrix}R^7\\R^8\end{matrix}>N-$基

其中,R^7含义同上,

R^8表示烷基、链烯基、炔基、烷氧基、链烯氧基、炔氧基或苯基(该基可由卤原子、烷基、烷氧基、卤化烷基、烷氧羰基以一个或一个以上取代)、

三甲基甲硅烷基、

氰基、

环氧乙烷基、

式R^8CO-基(基中R^8含义同上)、或者是

式$R^8-\underset{\underset{NOR^9}{\|}}{C}-$基

其中R^8含义同上,R^9表示烷基、链烯基、炔基、

(b)链烯基

所述链烯基可由以下的基团以一个或一个以上取代,

卤原子、

苯基(该基可由卤原子、烷基、烷氧基、卤代烷基、烷氧羰基以一个或一个以上取代)、

式 R^7O- 基(其中 R^7 含义同上)、

式 $R^7S(O)_n-$ 基(其中 R^7 和 n 的含义同上)、

式 $\begin{matrix}R^7\\R^8\end{matrix}>N-$ 基(其中 R^7 和 R^8 含义同上)、

三甲基甲硅烷基、

氰基、

式 R^8CO- 基(其中 R^8 含义同上)、或者是

式 R^8-C- 基(其中 R^8 和 R^9 含义同上)、

NOR^9

(c) 炔基、

(d) 环烷基、

所述环烷基可由以下基团以一个或一个以上取代:

卤原子、烷基、苯基(该基可由卤原子、烷基、烷氧基、卤代烷基、烷氧羰基以一个或一个以上取代)、

式 R^7O- 基(其中 R^7 含义同前)、

式 $R^7S(O)_n-$ 基(其中 R^7 和 n 的含义同前)、

式 $\begin{matrix}R^7\\R^8\end{matrix}>N-$ 基(其中 R^7 和 R^8 含义同前)、

三甲基甲硅烷基、

氰基、

氧、

式 $R^9ON=$ 基(式中 R^9 含义同前)、

式 R^8CO- 基(式中 R^8 含义同前)、或者是

式 $R^8-C(=NOR^9)-$ 基(其中 R^8 和 R^9 含义同前)、

(e) 环链烯基

所述环链烯基可由以下基团以一个或一个以上取代:

卤原子、

烷基、

苯基(该基可由卤原子、烷基、烷氧基、卤代烷基、烷氧羰基以一个或一个以上取代、

式 R^7O- (其中 R^7 含义同前)、

式 $R^7S(O)_n-$ 基(其中 R^7 和 n 的含义同前)、

式 $>N(R^7)(R^8)$ 基(其中 R^7 和 R^8 含义同前)、

三甲基甲硅烷基、

氰基、

氧、

式 $R^9ON=$ 基(式中 R^9 含义同前)、

式 R^8CO- 基(式中 R^8 含义同前)、或者是

式 $R^8-C(=NOR^9)-$ 基(其中 R^8 和 R^9 含义同上)、

(f) 式 $>N(R^5)(R^6)$ 基

式中 R^5 表示下述基团

(i) 烷基

所述烷基可由以下基团以一个或一个以上取代

卤原子、

环烷基、

式 R^7O- 基(其中 R^7 含义同前)、

式 $R^7S(O)_n-$ 基(其中 R^7 和 n 的含义同前)、

式 $\begin{matrix}R^7\\R^8\end{matrix}>N-$ 基(其中 R^7 和 R^8 含义同前)、

三甲基甲硅烷基、

氰基、

环氧乙烷基、

式 R^8CO- 基(式中 R^8 含义同前)、或者是

式 $R^8-\underset{\underset{NOR^9}{\|}}{C}-$ 基(其中 R^8 和 R^9 含义同前)、

(ii) 链烯基

所述链烯基可用以下基以一个或一个以上取代:

卤原子

苯基(该基可用卤原子、烷基、烷氧基、卤代烷锘、烷氧羰基以一个或一个以上取代)、

环烷基、

式 R^7O- 基(其中 R^7 含义同前)、

式 $R^7S(O)_n-$ 基(其中 R^7 和 n 的含义同前)、

式 $\begin{matrix}R^7\\R^8\end{matrix}>N-$ 基(其中 R^7 和 R^8 含义同前)、

三甲基甲硅烷基、

氰基、

式 R^8CO- 基(式中 R^8 含义同前)、或者是

式 R^8-C- 基(其中 R^8 和 R^9 含义同上)、

$$\overset{\overset{\|}{N}OR^9}{}$$

(iii) 炔基

(iv) 环烷基

所述环烷基可由以下基以一个或一个以上取代,

卤原子、

烷基、

苯基(该基可由卤原子、烷基、烷氧基、卤代烷基、烷氧羰基以一个或一个以上取代)、

式 R^7O- (其中 R^7 含义同前)、

式 $R^7S(O)_n-$ 基(其中 R^7 和 n 的含义同前)、

式 $\overset{R^7}{\underset{R^8}{>}}N-$ 基(其中 R^7 和 R^8 含义同前)、

三甲基甲硅烷基、

氰基、

氧、

式 $R^9ON=$ 基(式中 R^9 含义同前)、

式 R^8CO- 基(式中 R^8 含义同前)、或者是

式 R^8-C- 基(其中 R^8 和 R^9 同含义同前)、

$$\overset{\overset{\|}{N}OR^9}{}$$

(v) 环链烯基

所述环链烯基可由以下基以一个或一个以上取代

卤原子、

烷基、

苯基(该基可由卤原子、烷基、烷氧基、卤代烷基、烷氧羰基以一个或一个以上取代)、

式 R^7O- 基(其中 R^7 含义同前)、

式 $R^7S(O)_n-$ 基(其中 R^7 和 n 的含义同前)、

式 $\begin{matrix}R^7\\R^8\end{matrix}>N-$ 基(其中 R^7 和 R^8 含义同前)、

三甲基甲硅烷基、

氰基、

氧、

式 $R^9ON=$ 基(式中 R^9 含义同前)、

式 R^8CO- 基(式中 R^8 含义同前)、或者是

式 $R^8-\underset{\underset{NOR^9}{\|}}{C}-$ 基(其中 R^8 和 R^9 同含义同前)、

(vi) 式 R^7O- 基(式中 R^7 含义同前),

R^6 表示氢原子或 R^5,

R^5 和 R^6 既可互相独立,R^5、R^6 也可以与氮原子结合形成 3－8 员环,

(g) 式 $R^{10}\overset{\overset{O}{\|}}{C}-\overset{\overset{R^6\text{基}}{|}}{N}-$

式中 R^6 含义同前,

R^{10} 为

(i) 烷基

所述烷基可由以下基以一个或一个以上取代:

式 R^7O- 基(其中 R^7 含义同前)、

式 $R^7S(O)_n-$ 基(其中 R^7 和 n 的含义同前)、

式 $\begin{matrix}R^7\\R^8\end{matrix}>N-$ 基(其中 R^7 和 R^8 含义同前)、

氰基、

(ii)链烯基

所述链烯基可由以下基以一个或一个以上取代:

卤原子、

式 R^7O- 基(其中 R^7 含义同前)、

式 $R^7S(O)_n-$ 基(其中 R^7 和 n 的含义同前)、

式 $\begin{matrix} R^7 \\ R^8 \end{matrix}>N-$ 基(其中 R^7 和 R^8 含义同前)、或者是

氰基、

(iii)苯基

所述苯基可由以下基以一个或一个以上取代

卤原子、

烷基、

烷氧基、

卤代烷基、

烷氧羰基、

(h)式 $R^{10}SO_2(R^6)-$ 基(式中 R^6 和 R^{10} 含义同前)

R^2 表示氢原子或烷基 (该基可由烷氧基或烷氧羰基取代)、芳基或链烯基;

R^3 和 R^4 可以相同或不同,表示氢原子、卤原子、烷基、

式 R^7O- 基(其中 R^7 含义同前)、

式 $R^7S(O)_n-$ 基(其中 R^7 和 n 的含义同前)、

式 $\begin{matrix} R^7 \\ R^8 \end{matrix}>N-$ 基(其中 R^7 和 R^8 含义同前)、

卤代烷基,或

卤代烷氧基、

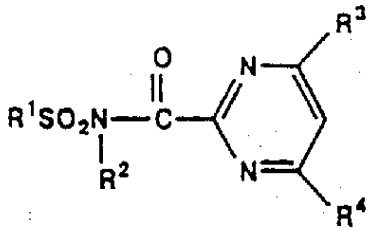
X 和 Y 可以相同或不同，表示次甲基或氮原子，但 X 和 Y 不能同时是次甲基。

通式 (I) 所表示的 N－磺酰基含氮 6 员芳香环羧酸酰胺衍生物中，存在有 E 体、Z 体等几何异构体，本发明还包括这些异构体任意一种以及这些异构体的任意比例的混合物。

在通式 (I) 中，举例来说，烷基可以是 1－10 个碳原子，链烯基可以是 2－8 个碳原子，炔基可以是 2－8 个碳原子，环烷基可以是 3－8 个碳原子，烷氧基可以是 1－6 个碳原子，卤原子可以是氯、溴、氟或碘。

下面的表 1 和表 2 中记录了本发明的化合物，化合物的编号在下文中仍参照使用。

表1



化合物编号	R^1	R^2	R^3	R^4	物理性质 熔点(℃)或 折射率(n_D^{20})
1	CH_3	H	CH_3O	CH_3O	211-213
2	CF_3	H	CH_3O	CH_3O	129-135
3	C_2H_5	H	CH_3O	CH_3O	196-198
4	C_3H_7	H	CH_3O	CH_3O	121-124
5	$i\text{-}C_3H_7$	H	CH_3O	CH_3O	182-184
6	C_4H_9	H	CH_3O	CH_3O	82- 83
7	C_5H_{11}	H	CH_3O	CH_3O	111-113
8	$i\text{-}C_4H_9$	H	CH_3O	CH_3O	128-130
9	$s\text{-}C_4H_9$	H	CH_3O	CH_3O	137-144
10	$i\text{-}C_5H_{11}$	H	CH_3O	CH_3O	96-100
11	C_6H_{13}	H	CH_3O	CH_3O	66- 69
12	$C_{10}H_{21}$	H	CH_3O	CH_3O	45- 48
13	$ClCH_2$	H	CH_3O	CH_3O	170-176
14	$ClCH_2CH_2CH_2$	H	CH_3O	CH_3O	116-119
15		H	CH_3O	CH_3O	105-109
16		H	CH_3O	CH_3O	133-135
17	$CH_2=CHCH_2$	H	CH_3O	CH_3O	118-120

表1 （续）

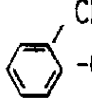
化合物编号	R^1	R^2	R^3	R^4	物理性质 熔点(℃)或 折射率(n_D^{20})
18.		H	CH_3O	CH_3O	148-152
19	$CH_2=C(CH_3)CH_2$	H	CH_3O	CH_3O	107-109
20	$ClCH=CHCH_2$	H	CH_3O	CH_3O	104-106
21	$(CH_3)_3CCH_2$	H	CH_3O	CH_3O	105-108
22		H	CH_3O	CH_3O	115-118
23	$CH_2=C(Cl)CH_2$	H	CH_3O	CH_3O	125-130
24	$ClCH=C(Cl)CH_2$	H	CH_3O	CH_3O	132-135
25	$CH_2=CH$	H	CH_3O	CH_3O	186-189
26	$CH_3OCOCH_2CH_2$	H	CH_3O	CH_3O	108-111
27	CH_3OCOCH_2	H	CH_3O	CH_3O	95- 98
28	CH_3	H	CH_3O	C_3H_7	143-147
29	CH_3	H	C_3H_7	C_3H_7	145-147
30	C_2H_5	H	C_3H_7	C_3H_7	153-156
31	C_2H_5	H	CH_3O	C_3H_7	170-174
32	C_3H_7	H	C_3H_7	C_3H_7	93- 97
33	C_4H_9	H	C_3H_7	C_3H_7	70- 76
34	C_3H_7	H	Cl	$(CH_3)_2N$	112-115
35	C_3H_7	H	C_2H_5O	C_2H_5O	108-110
36	C_3H_7	H	CH_3O	CH_3	98-102
37	C_3H_7	H	CH_3O	$(CH_3)_2N$	134-137
38	$i\text{-}C_4H_9$	H	Cl	$(CH_3)_2N$	103-108
39	$i\text{-}C_4H_9$	H	CH_3O	CH_3	1.5163
40	$i\text{-}C_4H_9$	H	CH_3O	$(CH_3)_2N$	
41	$i\text{-}C_4H_9$	H	CH_3O		120-122

表1 （续）

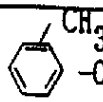
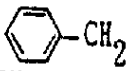
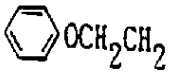
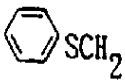
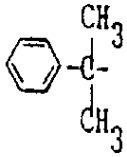
化合物编号	R^1	R^2	R^3	R^4	物理性质 熔点(℃)或折射率(n_D^{20})
42	C_3H_7	H	CH_3O		100-102
43	i-C_4H_9	H	CH_3	CH_3	1.5169
44	$(CH_3)_3CCH_2$	H	CH_3O	C2H5O	80- 82
45	s-C_4H_9	CH_3OCH_2	CH_3O	CH_3O	1.5094
46	C_3H_7	CH_3	CH_3O	CH_3O	106-109
47	C_3H_7		CH_3O	CH_3O	125-127
48	C_3H_7	CH_3OCH_2	CH_3O	CH_3O	59- 62
49	C_3H_7	$C_2H_5OCOCH_2$	CH_3O	CH_3O	89- 93
50	C_3H_7	$CH_2=CHCH_2$	CH_3O	CH_3O	128-132
51	C_3H_7	$C_2H_5OCOCH(CH_3)$	CH_3O	CH_3O	1.4733
52	$CH\equiv CCH_2$	H	CH_3O	CH_3O	144-150
53	$CH_3OCH_2CH_2$	H	CH_3O	CH_3O	
54	$NCCH_2CH_2$	H	CH_3O	CH_3O	173-175
55	$NCCH_2$	H	CH_3O	CH_3O	
56	$CH_3CH_2CH(CH_3)CH_2$	H	CH_3O	CH_3O	107-110
57		H	CH_3O	CH_3O	90- 92
58		H	CH_3O	CH_3O	99-100
59		H	CH_3O	CH_3O	
60	CH_3SCH_2	H	CH_3O	CH_3O	125-126

表1 （续）

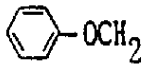
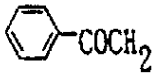
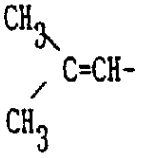
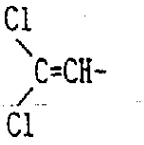
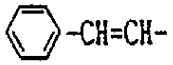
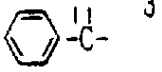
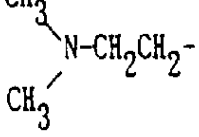
化合物编号	R^1	R^2	R^3	R^4	物理性质 熔点(℃)或折射率(n_D^{20})
61		H	CH_3O	CH_3O	
62		H	CH_3O	CH_3O	147-149
63		H	CH_3O	CH_3O	
64		H	CH_3O	CH_3O	125-128
65	CF_3CH_2-	H	CH_3O	CH_3O	141-143
66		H	CH_3O	CH_3O	173-176
67	$HOCH_2CH_2$	H	CH_3O	CH_3O	101-105
68		H	CH_3O	CH_3O	120-122
69		H	CH_3O	CH_3O	

表1 （续）

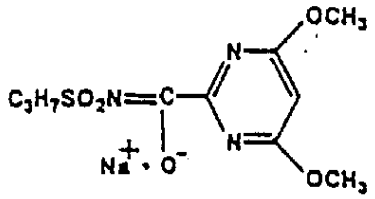
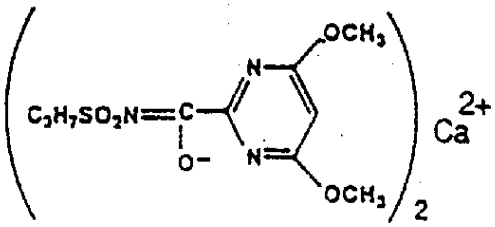
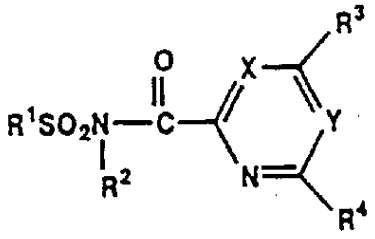
化合物编号	R^1	R^2	R^3	R^4	物理性质 熔点(℃)或 折射率(n_D^{20})
70					161-164
71					89- 93
72	$CH_3-\underset{\underset{Cl}{|}}{C}=CHCH_2CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	
73	$-CH=CHCH_2CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	
74	$CH_3CH=CHCH_2CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	

表2



化合物编号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	Y	物理性质 熔点(℃)或折射率(n_D^{20})
75	$BrCH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	165-168
76	$ClC(CH_3)=CHCH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	119-122
77	$CH_3CH=C(CH_3)CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	76-79
78	$ClC(CH_3)CH_2CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	115-118
79	$BrCH_2CH(Br)CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	113-115
80	$CH_2=C(CH_3)-CH_2CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	94-96
81	$(C_2H_5)_2CHCH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	80-82
82	$C_3H_7CH(CH_3)-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	124-125
83	$CH_3ON=C(C_6H_5)-CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	136-139
84	$C_2H_5ON=C(C_6H_5)CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	132-135
85	$Cl_2C=CHCH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	118-121
86	$C_2H_5OCO-CH(CH_3)-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	119-121

表2 （续）

化合物编号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	Y	物理性质 熔点(℃)或折射率(n_D^{20})
87	$C_2H_5OCO-\underset{\underset{C_2H_5}{\vert}}{CH}-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	97-98
88	$CH_3SCH=CH-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	129-132
89	$CH_3SCH_2CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	117-118
90	$CF_3CF_2CF_2CF_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	100-102
91	$CF_3CH_2CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	147-149
92	$CF_2=CFCH_2CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	100-106
93	$ClCH=\underset{\underset{CH_3}{\vert}}{C}-CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	101-105
94	$ClCH_2\underset{\underset{CH_3}{\vert}}{CH}-CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	1.529
95	$CH_2=\underset{\underset{Br}{\vert}}{C}-CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	105-106
96	$CH_3CH=\underset{\underset{Cl}{\vert}}{C}-CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	128-129
97	$BrCH=CHCH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	106-110
98	$C_2H_5SCH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	120-121
99	$i\text{-}C_3H_7\text{-}SCH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	107-108
100	$CH_3SO_2CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	218-220
101	$C_2H_5SOCH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	154-157
102	$C_2H_5SO_2\underset{\underset{CH_3}{\vert}}{CH}_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	173-178
103	$CH_3\text{-}\underset{\underset{CH_3}{\vert}}{Si}\text{-}CH_2CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	86-89
104	$C_2H_5CH=CH-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	98-102
105	$(CH_3)_2N-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	159-162
106	$ClCH_2\underset{\underset{Cl}{\vert}}{CH}-CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	126-128

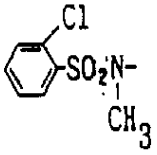
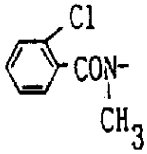
表2 （续）

化合物编号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	Y	物理性质 熔点(℃)或折射率(n_D^{20})
107	$CH_2=C(C_6H_5)-CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	无法测定
108	$i\text{-}C_3H_7\text{-}SO_2CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	163-164
109	$i\text{-}C_3H_7\text{-}SOCH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	175-176
110	$C_2H_5OCOCH=CHCH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	127-129
111	$(CH_2=CHCH_2)_2N-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	74-76
112	$C_6H_5CH(CH_3)-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	117-119
113	$C_6H_5CH(C_2H_5)-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	149-151
114	$C_6H_5CH(C_3H_7)-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	131-133
115	$CH_2=CHCH_2CH(C_6H_5)-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	134-135
116	$(C_2H_5)_2N-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	128-129
117	$CH_2=CHCH_2CH(CH_3)-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	90-91
118	$i\text{-}C_3H_7\text{-}NH-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	167-169
119	$t\text{-}C_4H_9\text{-}NH-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	216-219
120	$CH_3CH=CH-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	157-159
121	$C_2H_5CH(CH_3)\text{-}NH-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	154-156
122	$CH_2=CHCH_2NH-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	129-132
123	$i\text{-}C_3H_7\text{-}CH_2NH-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	118-119
124	$CH_2=CHCH_2CH(OCOC_2H_5)-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	79-80

表2 （续）

化合物编号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	Y	物理性质 熔点(℃)或折射率(n_D^{20})
125	CH_3NH-	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	233-234
126	C_2H_5NH-	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	190-193
127	C_3H_7NH-	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	123-124
128	C_4H_9NH-	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	119-121
129	$CH\equiv CCH_2NH-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	167-169
130	$CH_3OCO-CH(C_3H_7-i)-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	108-110
131	$CH_3OCO-CH(C_3H_7)-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	82-83
132		H	CH_3O	CH_3O	N	CH	112-113
133		H	CH_3O	CH_3O	N	CH	107-109
134		H	CH_3O	CH_3O	N	CH	140-141
135		H	CH_3O	CH_3O	N	CH	208-210
136		H	CH_3O	CH_3O	N	CH	136-139
137		H	CH_3O	CH_3O	N	CH	151-153
138		H	CH_3O	CH_3O	N	CH	121-122
139	$ClCH=C(Cl)-CH_2-$	H	CH_3O	CH_3	N	CH	142-145
140	$CH_2=C(CH_3)-CH_2-$	H	CH_3O	CH_3	N	CH	103-105

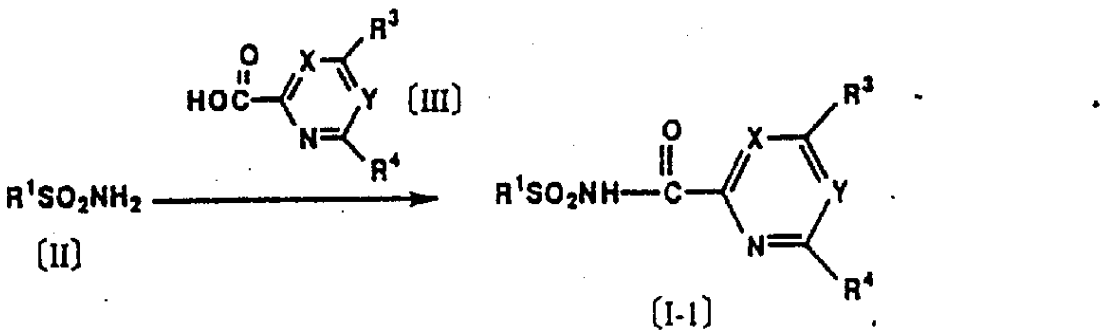
表2 （续）

化合物编号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	Y	物理性质 熔点(℃)或折射率(n_D^{20})
141	$ClCH=C(CH_3)-CH_2-$	H	CH_3O	CH_3	N	CH	127-128
142	$ClCH=C(Cl)-CH_2-$	H	CH_3	CH_3	N	CH	无法测定
143	$ClCH=C(Cl)-CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	CH	N	120-125
144	$CH_2=C(CH_3)-CH_2-$	H	CH_3O	CH_3O	CH	N	110-111
145	$ClCH=CHCH_2-$	CH_3OCH_2	CH_3O	CH_3O	N	CH	92-96
146	$CH_2=C(CH_3)-CH_2-$	CH_3OCH_2	CH_3O	CH_3O	N	CH	1.5128
147	$ClCH=C(Cl)-CH_2-$	H	Cl	$(CH_3)_2N-$	N	CH	164-170
148	$CH_2=C(CH_3)-CH_2-$	H	Cl	$(CH_3)_2N-$	N	CH	157-158
149	$ClCH=C(CH_3)-CH_2-$	H	Cl	$(CH_3)_2N-$	N	CH	148-151
150	$C_2H_5CH(CH_3)-CH_2-$	H	Cl	$(CH_3)_2N-$	N	CH	90-94
151	$ClCH=C(Cl)-CH_2-$	H	CH_3O	$(CH_3)_2N-$	N	CH	110-113
152	$CH_2=C(CH_3)-CH_2-$	H	CH_3O	$(CH_3)_2N-$	N	CH	125-127
153	$ClCH=C(CH_3)-CH_2-$	H	CH_3O	$(CH_3)_2N-$	N	CH	165-170
154		H	CH_3O	CH_3O	N	CH	154-156
155		H	CH_3O	CH_3O	N	CH	142-143
156	$ClCH=CHCH_2-$ (Z)	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	162-163
157	$ClCH=CHCH_2-$ (E)	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	125-127
158	$CH_3ON(CH_3)-$	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	144-145
159	CH_3ONH-	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	
160	C_2H_5ONH-	H	CH_3O	CH_3O	N	CH	

本发明的化合物可以按下面所述的制造方法A—E制备。

制造方法A

(反应式1)



(式中R^1、R^3、R^4、X和Y的含义与前面的定义相同)。

即，在存在缩合剂的情况下，使(II)式所表示的化合物与1—1.5当量的(III)式所表示的化合物在溶剂中反应，就可以制得通式(I—I)所示的化合物。

缩合剂可以举出的有氰基磷酸二乙酯、N，N′—羰基二咪唑、亚硫酰二氯以及N，N′—二环已基碳化二亚胺等。

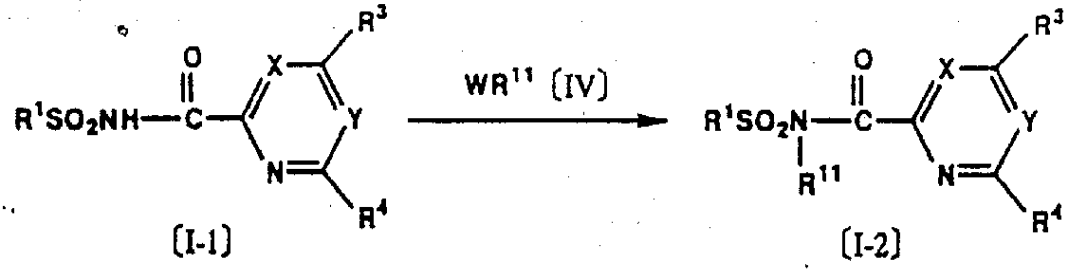
溶剂可以举出的有苯、甲基、二甲苯、二氯甲烷、氯仿、乙醚、四氢呋喃、二 恶烷、乙腈、N，N—二甲基甲酰胺、N，N—二甲基乙酰胺、二甲基亚砜等。

必要时，反应可以在三乙胺、氢化钠、吡啶等碱共存的条件下进行。

反应可以在—20℃至+50℃的适宜温度下进行30分钟至20小时。

制造方法B

(反应式2)



〔I-1〕　　〔I-2〕

[式中W表示卤原子、R^1、R^3、R^4、X和Y的含义同上，R^{11}表示烷基(该基可以由烷氧基或烷氧羰基取代)、苄基或链烯基。]

即，使(I－1)式所示的化合物与1－1.5当量的(IV)式所示的化合物在存在碱的条件下于溶剂中进行反应，即可制得通式(I－2)所示的化合物。

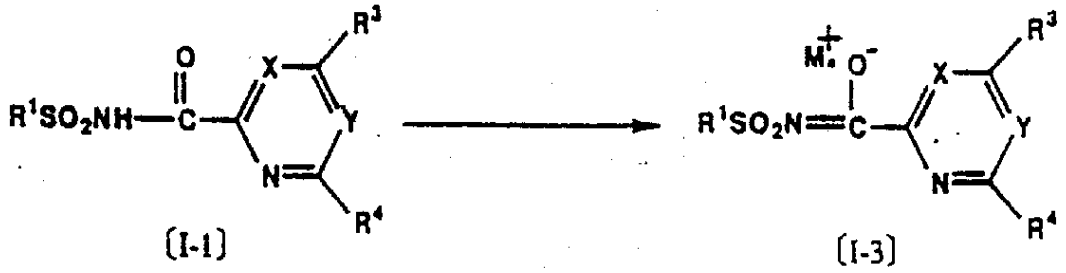
所述的碱例如可以是氢化钠、三乙胺、吡啶等。

溶剂例如可以是苯、甲苯、二甲苯、乙醚、四氢呋喃、二 恶烷、乙腈、 N，N－二甲基甲酰胺、N，N－二甲基乙酰胺、二甲亚砜等。

反应在－20℃至+50℃的适宜温度下进行30分钟至20小时即可。

制造方法C

(反应式3)



〔I-1〕　　〔I-3〕

(式中M'表示碱金属离子、碱土金属离子、铵离子、 有机胺离子及过渡金属离子、R^1、R^3、R^4、X和Y的含义同上)。

即，使(I－1)式所示的化合物与0.5－1当量的碱在溶剂中反应即可制得通式(I－3)所示的化合物。

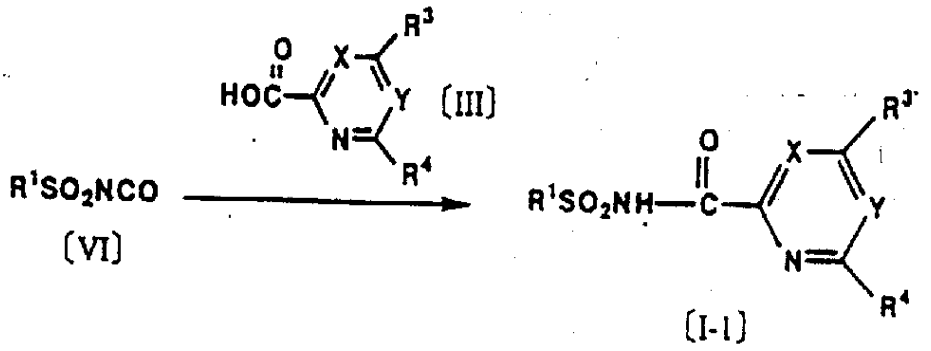
所述的碱例如可以是钠、钾等碱金属类，氢化钠、氢化钾、氢化钙等碱金属氢化物和碱土金属氢化物、氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化钙等碱金属氢氧化物和碱土金属氢氧化物，甲醇钠、叔丁醇钾等碱金属醇盐，氨、异丙基胺等有机胺类等。

溶剂例如可以是苯、甲苯、二甲苯基、乙醚、四氢呋喃、二恶烷、乙腈、甲醇、乙醇、N，N—二甲基乙酰胺、二甲亚砜、水等。

反应在—20℃至+50℃的适宜温度下进行30分钟至20小时即可。

制造方法D

(反应式4)



(式中R^1、R^3、R^4、X和Y的含义同上。)

即，使(VI)式所示的化合物与1—1.5当量的(III)式所示化合物在溶剂中反应，就可以制得通式(I—1)所示的化合物。

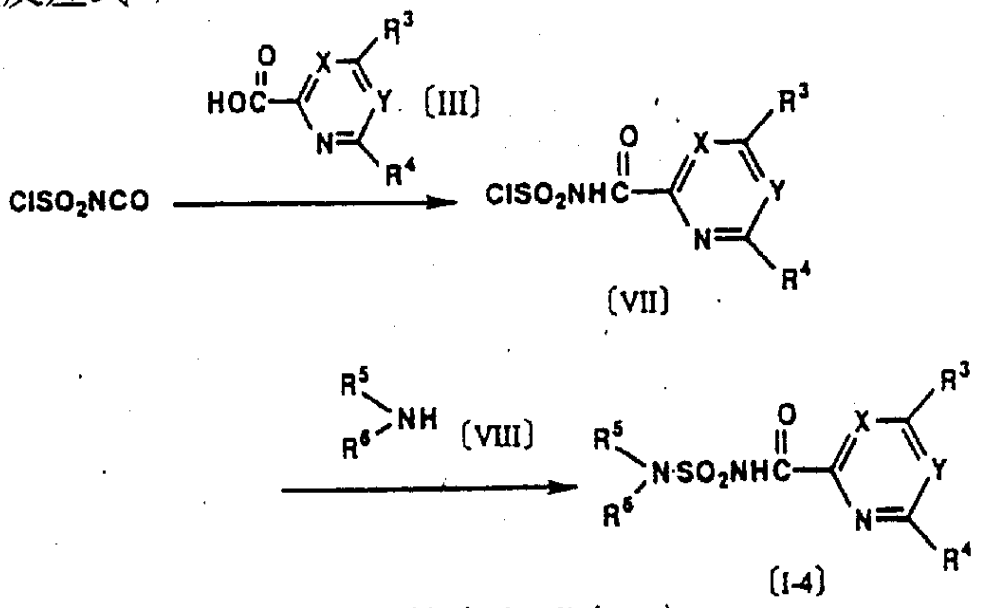
可以举出的溶剂有苯、甲苯、二甲苯、二氯甲烷、氯仿、乙醚、四氢呋喃、二恶烷、乙腈、N，N—二甲基甲酰胺、N，N—二甲基乙酰胺、二甲亚砜等。

必要时，反应可在有三乙胺、氢化钠、吡啶等碱共存的情况下进行。

反应在—20℃至+50℃的适宜温度下进行30分钟至20小时即可。

制造方法E

(反应式5)



(式中R^3、R^4、R^5、R^6、X和Y的含义同上。)

即，使(VII)式的化合物与(VIII)式的化合物在溶剂中反应，即可制得通式(I－4)所示的化合物。

必要时，这一反应可以在三乙胺、氢化钠、吡啶等碱共存的情况下进行。

(VII)式所表示的化合物可以通过使(III)式的化合物与1－1.5当量的氯磺酰基异氰酸酯在溶剂中反应来制备。

无论是哪一个反应，溶剂例如都可以用苯、甲苯、二甲苯、二氯甲烷、氯仿、乙醚、四氢呋喃、二 恶烷、乙腈、二甲亚砜等，反应在－20℃至+50℃的适宜温度下进行30分钟至20小时即可。

下面举实施例来具体地说明本发明化合物的制造方法。

实施例1

N－异丁基磺酰基－4，6－二甲氧基嘧啶－2－羧酸酰胺(化合物编号8)的合成

将2.0g(11毫摩尔)的4，6－二甲氧基嘧啶－2－羧酸溶解在20mlN，N－二甲基甲酰胺中，添加1.8g(11毫摩尔)N，N－羰基二咪

唑，在室温下搅拌1小时，调制4，6—二甲氧基嘧啶—2—羰基咪唑的N，N—二甲基甲酰胺溶液。然后将1.5g(11毫摩尔)异丁基氨磺酰溶解于20mlN，N—二甲基甲酰胺中，添加0.5g(12毫摩尔)60% 氢化钠，在室温下搅拌1小时后缓慢地滴加上述4，6—二甲氧基嘧啶—2—羰基咪唑的N，N—二甲基甲酰胺溶液。 在室温下搅拌该反应液3小时，然后将其置于冰水中，用稀盐酸调整至PH2—3， 用200ml乙酸乙酯萃取2次：萃取液经水洗并用无水硫酸镁干燥后，减压浓缩，得到3.1g粘稠液体。利用硅胶柱色谱法提纯(乙酸乙酯：己烷=1：1)，得到2.7g(收率82.0%)白色粒状晶体的目标产物， 熔点为128—130℃。

实施例2

N—(2—氯—2—丙烯基磺酰基)—4，6—二甲氧基嘧啶—2—羧酸酰胺(化合物编号23)的合成

将2.4g(13毫摩尔)4，6—二甲氧基嘧啶—2—羧酸、2.0g(13毫摩尔)2—氯—2—丙烯基氨磺酰和3.9g(39毫摩尔)三乙胺溶解在50ml二氯甲烷中，在室温下搅拌30分钟，然后添加3.0g(13毫摩尔)70%氰基磷酸二乙酯，在室温下搅拌一夜。用稀盐酸洗涤反应液，除去过剩的三乙胺，然后用50ml饱和碳酸氢钠水溶液萃取，萃取液用稀盐酸调节成PH2—3，用200ml乙酸乙酯萃取2次，萃取液经水洗并用无水硫酸镁干燥后，减压浓缩，得到1.8g粘稠液体。用硅胶柱色谱法提纯(乙酸乙酯：己烷=1：1)，得到1.4g(收率33.7%)黄色粉末状的目标产物，溶点125—130℃。

实施例3

4， 6—二甲氧基—N—甲氧甲基—N—丙基磺酰基嘧啶—2—羧

酸酰胺(化合物编号48)的合成

将2.0g(6.8毫摩尔)4，6—二甲氧基—N—丙基磺酰基嘧啶—2—羧酸酰胺溶解在100mlN，N—二甲基甲酰胺中，一点一点地添加0.32g(8.0毫摩尔)氢化钠，在室温下搅拌1小时。向反应液中添加0.54g(6.8毫摩尔)甲氧基氯代甲烷，在室温下搅拌1小时。将反应液置于水中，用甲苯萃取，有机层用无水硫酸镁干燥，然后减压浓缩，得到4，6—二甲氧基—N—甲氧甲基—N—丙基磺酰基嘧啶—2—羧酸酰胺的粗产物，用硅胶柱色谱法提纯(乙酸乙酯：己烷=1：1)，得到0.5g(收率22.1%)的白色粉末状的目标产物，熔点59—62℃。

实施例4

4，6—二甲氧基—N—丙基磺酰基嘧啶—2—羧酸酰胺钠盐(化合物编号70)的合成。

将1.0g(3.5毫摩尔)4，6—二甲氧基—N—丙基磺酰基嘧啶—2—羧酸酰胺溶解于20ml甲醇中，添加0.7g(3.6毫摩尔)28%甲醇钠，在室温下搅拌1小时，浓缩反应液，将残渣加到乙醚中，滤出结晶体，用乙醚洗涤后干燥，得到0.9g白色粉末状的目标产物，熔点161—164℃。

实施例5

4，6—二甲氧基—N—丁基磺酰基嘧啶—2—羧酸酰胺(化合物编号6)的合成

将3.0g(16毫摩尔)4,6—二甲氧基嘧啶—2—羧酸、2.6g(16毫摩尔)丁基磺酰基异氰酸酯、1.8g(16毫摩尔)三乙胺溶解在200ml氯仿中，在室温下搅拌6小时，反应液用10%盐酸和水洗涤，然后用无水硫酸镁干燥，减压浓缩，得到4，6—二甲氧基—N—丁基磺酰基嘧

啶－2－羧酸酰胺的粗产物。用硅胶柱色谱法提纯(乙酸乙酯：己烷=1：1)，得到1.5g(收率30.3%)白色粉末状的目标产物，熔点82－83℃。

实施例6

4，6－二甲氧基－N－(异丙基氨基磺酰基)嘧啶－2－羧酸酰胺(化合物编号118)的合成

将3.0g(16毫摩尔)4，6－二甲氧基嘧啶－2－羧酸溶解于100ml二氯甲烷中，一点一点地添加2.8g(20毫摩尔)氯磺酰基异氰酸酯，在室温下搅拌1小时，缓慢地向反应液中添加3.0g(50毫摩尔)异丙基胺，在室温下再搅拌3小时。反应液用10%盐酸和水洗涤，然后用无水硫酸镁干燥有机层，减压浓缩后得到4，6－二甲氧基－N－(异丙基氨基磺酰基)嘧啶－2－羧酸酰胺的粗产物，用硅胶柱色谱法提纯(乙酸乙酯：己烷=1：3)，得到0.8g(收率16.0%)白色粉末状的目标产物，熔点167－169℃。

本发明的有害生物防除剂含有通式(I)所示的N－磺酰基含氮6员芳香环羧酸酰胺衍生物作为有效成分。本发明的化合物用作有害生物防除剂时，根据使用目的可以将有效成分制成适当的剂型使用。通常，有效成分要用惰性的液体或固体载体加以稀释，必要时可以添加表面活性剂及其它添加剂，以粉剂、可湿性粉剂、乳剂、粒剂等剂型使用。

适用的载体例如可以举出滑石、膨润土、粘土、高岭土、硅藻土、白炭黑、蛭石、消石灰、石英砂、硫酸铵、尿素等固体载体以及异丙醇、二甲苯、环己酮、甲基萘等液体载体。表面活性剂和分散剂例如可以举出二萘甲烷磺酸盐、醇硫酸酯盐、烷芳基磺酸盐、木质磺酸盐、聚氧乙烯乙二醇醚、聚氧乙烯烷基芳基醚、聚氧乙烯山梨糖醇酐一烷基化物等。辅助剂可以举出羧甲基纤维素等。这些

制剂稀释成适宜的浓度后撒布或直接施用。

本发明的有害生物防除剂可以采用茎叶撒布、土壤施用或水面施用的方式使用。有效成分的配比可根据需要适当选择，在粉剂和粒剂的情况下以0.1—20%(重量)为宜，在乳剂和可湿性粉剂的情况下以5—80%(重量)为宜。

本发明的有害生物防除剂的施用量，根据所用化合物的种类、要防治的病害、发生倾向、病害的程度、环境条件、使用的剂型等而有所不同。例如，以粉剂和粒剂使用时，可以在每10公亩有效成分为0.1g-5kg，最好是1g-1kg的范围内适当地选择；以乳剂和可湿性粉剂等液态形式使用时，可以在0.1ppm-10000ppm、最好是10ppm-3000ppm的范围内适当地选择。

本发明的有害生物防除剂，以上述施用形式，可以防除由于藻菌纲(Oomycetes)类的菌而引起的植物病害。下面列举的具体的菌名是非限定性的实例：假霜霉属(Pseudoperonospora)，例如黄瓜霜霉病菌(Pseudoperonospora cubensis)；单轴霉属(Plasmopara)，例如葡萄霜霉病菌；疫霉属(Phytophthora)，例如西红柿疫霉病菌等。

另外，本发明的有害生物防除剂可根据需要与杀虫剂、杀菌剂、除草剂、植物生长调节剂、肥料等混合使用。下面举出本发明的有害生物防除剂的有代表性的制剂的例子并以此来具体地说明制备制剂的方法。下文中的%表示重量百分数。

制剂例1　　粉剂

将化合物(93)2%、硅藻土5%和粘土93%均匀混合、粉碎，制成粉剂。

制剂例2　　可湿性粉剂

将化合物(95)50%、硅藻土45%、二萘甲烷二磺酸钠2%和木质磺酸钠3%均匀混合、粉碎，制成可湿性粉剂。

制剂例3　　乳剂

将化合物(80)30%、环己酮20%、聚氧乙烯烷基芳基醚11%、烷基苯磺酸钙4%和甲基萘35%均匀溶解，制成乳剂。

制剂例4　　粒剂

将化合物(98)5%、月桂醇硫酸酯的钠盐2%、木质磺酸钠5%、羧甲基纤维素2%和粘土86%均匀混合粉碎。在该混合物中加入水20%并混练均匀，用挤出式制粒机加工成14—32目大小的颗粒，干燥后得到粒剂。

本发明的有害生物防除剂还可以作为除草剂，用来防除有害杂草。在这种情况下制剂的形式和使用方法等最好按照最适合于除草剂用途的条件来进行，不过，即使按照上述的有害生物防除剂的各种条件来使用也能充分地达到这一目的。

本发明的N—磺酰基含氮6员芳香环羧酸酰胺，与特开平2—282371中所述的化合物相比，对于由属于藻菌纲的植物病原菌而引起的病害，特别是对于霜霉病、芋疫病，以较低的浓度即显示出良好的预防效果，同时还具有良好的治疗效果。另外，还具有良好的残效性、耐雨性等特点。

此外，本发明的化合物还可以防除旱田和水田中发生的杂草。对于旱田中的各种杂草，例如，主要是酸模叶蓼、西风古、藜、ノアサガオ、苍耳等阔叶杂草，此外还有莎草、キハマスゲ、水蜈蚣、莎草、碎米莎草等多年生和一年生莎草属杂草以及稗草、约翰

逊草、ノスズメノテッポゥ等稻科杂草，从发芽前到生长期的很宽的范围内发挥良好的除草效果。另外，还可以防除水田中发生的稗属、小花、雨久花等一年生杂草和慈祜、水莎草、油莎草、萤蔺、泽泻属等多年生杂草。

适用的作物有水稻、一般的旱田作物、果树等。

下面，举试验例来具体地说明本发明的有害生物防除剂的效果。

试验例1　黄瓜霜霉病预防效果试验

在若干个9cm×9cm的聚乙烯制成的盆中分别播种12粒黄瓜种子(品种:相模半白)，在温室中培育7日。将按制剂2调制的可湿性粉剂用水稀释至有效成分为500ppm，撒到子叶展开的黄瓜幼苗上，每一盆的用量为10ml。风干后，喷雾接种黄瓜霜霉病菌(Pseudoperonospora cubensis)的分生孢子悬浮液，然后立即放入22℃的湿室内，过24小时后移到温室内，接种7天后，按下述标准调查、评定所有盆中的发病程度。结果示于表3中。

另外，用特开平2—282371中记载的下列化合物作为对比试剂。

对比化合物A　N—(2—氯苯基磺酰基)—4，6—二甲氧基嘧啶—2—羧酸酰胺

对比化合物B　N—(2，6—氯苯基磺酰基)—4，6—二甲氧基嘧啶—2—羧酸酰胺

评价	发病面积
A	未发病
B	发病面积小于25%
C	发病面积25%至50%
D	发病面积50%以上

表 3

化合物编号	预防效果評价
3	A
4	A
5	A
6	A
8	A
9	B
14	A
17	A
18	A
19	A
20	A
22	A
23	A
24	A
48	B
77	A
78	B
79	A
81	A
93	A
94	A

化合物编号	预防效果評价
95	A
96	A
98	A
104	A
105	B
106	B
116	A
120	A
121	B
129	A
132	B
135	A
139	A
145	A
147	B
151	A
152	A
153	A
比较A	D
比较B	D

试验例2 黄瓜霜霉病治疗效果试验

在若干9cm×9cm的聚乙烯制成的盆中分别播种12粒黄瓜种子(品种:相模半白)，在温室内培养7天。在子叶展开的黄瓜幼苗上喷雾接种黄瓜霜霉病菌(Pseudoperonospora cubensis)的游动孢子囊悬浮液，然后立即转移到22℃的湿室内放置24小时，风干后，将按制剂例2调制的可湿性粉剂稀释成有效成分为500ppm， 在每个盆中撒10ml。然后将其转移至温室内，接种7天后按照与试验例1相同的方法，调查、评价所有盆中的发病程度，结果示于表4中。

表4

化合物编号	治疗效果評价	化合物编号	治疗效果評价
3	B	22	A
4	B	23	B
5	A	24	B
6	A	48	B
8	B	79	A
9	B	93	B
14	A	94	B
17	A	95	A
18	A	96	B
19	A	98	B
20	A	145	A

试验例3　水田土壤处理的除草效果试验

在100cm²的塑料盆中填充水田土壤，耙地后播种稗属(Eo)、鸭舌草(Mo)和萤蔺(Sc)的种子，灌水至3cm水深。第二天，将按制剂例2调制的可湿性粉剂用水稀释，滴到水面上。施用量为每10公亩使用100g有效成分。然后在温室内培育，在处理的第21天，按表5的标准，调查除草效果。结果示于表6中。

对比试剂使用与试验例1相同的化合物。

表5

指数	除草效果及药害(生育抑制程度)
5	90%以上的除草效果、药害
4	70%－90%的除草效果、药害
3	50%－70%的除草效果、药害
2	30%－50%的除草效果、药害
1	10%－30%的除草效果、药害
0	不到10%的除草效果、药害

表6

化合物编号	除草效果		
	Eo	Mo	Sc
3	5	5	5
4	5	5	5
5	5	5	5
6	5	5	5
8	5	5	5
9	5	5	5
14	4	5	5
15	5	5	5
17	5	5	5
18	5	5	5
19	5	5	5
20	5	5	5
21	5	5	5
22	5	5	5
23	5	5	5
24	5	5	5
38	5	5	3
39	5	5	5
40	5	5	3
43	5	5	3
44	5	5	5
45	5	5	5
48	5	5	5
52	5	5	5
56	5	5	5
77	5	5	5
79	5	5	5
80	5	5	5

81	5	5	5
82	5	5	4
85	5	5	4
93	5	5	5
94	5	5	5
95	5	5	5
96	5	5	5
97	5	5	5
98	5	5	5
101	5	5	4
104	5	5	5
106	5	5	5
118	5	5	5
119	5	5	5
120	5	5	5
121	5	5	5
122	5	5	5
132	5	5	5
134	5	5	3
139	5	5	5
140	5	5	5
141	5	5	5
142	5	5	5
145	5	5	5
146	5	5	5
147	5	5	5
148	5	5	5
149	5	5	3
150	5	5	3
151	5	5	5

152	5	5	5
153	5	5	5
156	5	5	5
比较A	1	3	1
比较B	1	3	1

试验例4(旱地土壤处理的除草效果试验)

在120cm²的塑料盆中填充旱地土壤，播种食用湖南稷子(Ec)、酸模叶蓼(Po)、西风古(Am)、藜(Ch)、碎米莎草(Ci)的种子，盖上覆土。将按制剂例2调制的可湿性粉剂用水稀释，按每10公亩使用有效成分400g的比例，用小型喷雾器在每10公亩的土壤表面上均匀地喷洒100升稀释液。然后在温室内培育，在处理后的第21日按表5所列的基准来调查除草效果。所获结果示于表7中。

对比试剂使用与试验例1相同的化合物。

表7

化合物编号	除草效果				
	Ec	Po	Am	Ch	Ci
3	4	4	5	4	5
4	5	5	5	5	5
5	5	5	5	5	5
6	5	5	5	5	5
8	5	5	5	5	5
9	5	5	5	5	5
14	5	4	5	5	5
15	5	5	5	3	5
17	5	5	5	4	5
18	4	5	5	5	5
19	5	5	5	5	5
20	5	5	5	5	5
21	5	5	5	5	5
22	5	5	5	5	5
23	5	5	5	5	5
24	5	5	5	5	5
36	3	4	5	5	4
38	5	5	5	4	5
39	5	4	5	5	5
40	5	4	5	4	5
43	4	4	5	4	5
44	5	5	5	5	4
45	5	4	5	5	5
56	5	4	5	4	5
60	4	4	5	5	5
77	5	5	5	5	5
79	5	5	5	5	5
93	5	5	5	5	5

94	4	5	5	5	5
95	5	5	5	5	5
96	5	5	5	5	5
97	5	5	5	5	5
104	5	5	5	5	5
106	4	5	5	5	5
116	5	4	4	5	5
120	5	5	5	5	5
121	5	5	5	5	5
122	5	5	5	5	5
132	4	4	5	5	5
139	5	5	5	5	5
140	5	4	5	5	5
141	5	5	5	5	5
142	5	5	5	5	5
145	5	5	5	5	5
146	5	5	5	5	5
147	4	4	5	5	5
148	5	5	4	4	5
149	4	4	5	5	5
151	5	5	5	5	5
152	5	4	5	5	5
153	4	5	5	5	5
156	5	5	5	5	5
比較A	0	0	4	1	0
比較B	0	0	0	0	0

试验例5(旱地茎叶处理的除草效果试验)

在120cm²的塑料盆中填充旱在土壤,播种食用湖南稷子(Ec)、酸模叶蓼(Po)、西风古(Am)…、藜(Ch)、碎米莎草(Ci)的种子,在温室内培育2周,然后,将按制剂例2调制的可湿性粉剂用水稀释,按每10公亩有效成分400g用小型喷雾器从植物体上方撒到全体茎叶上,每10公亩撒100升稀释液。然后在温室中培育,在处理后的第14天,按表5中的标准调查除草效果,结果示于表8中。

对比试剂使用与试验例1相同的化合物。

表8

化合物编号	除草效果				
	Ec	Po	Am	Ch	Ci
4	5	4	5	5	5
5	5	4	5	5	5
6	5	4	5	5	5
8	5	5	5	5	5
9	5	4	5	5	5
14	5	3	5	5	5
17	5	5	5	4	5
18	4	3	5	5	4
19	5	5	5	5	5
20	5	5	5	5	5
21	5	5	5	5	5
22	5	5	5	5	5
23	5	5	5	5	5
24	5	5	5	5	5
38	4	4	5	4	3
39	4	5	5	4	4
40	4	4	5	4	4
44	5	4	5	5	5
45	5	5	5	5	5
52	5	5	5	5	5
56	5	5	5	5	5
60	5	5	5	5	5
77	5	5	5	5	5
79	4	5	5	5	5
81	5	5	5	5	5
93	5	5	5	5	5
94	5	5	5	5	5
95	5	5	5	5	5
96	5	5	5	5	5

97	5	5	5	5	5
104	5	5	5	5	5
106	3	5	5	5	4
116	5	4	5	4	5
118	5	5	5	5	5
120	5	5	5	5	5
121	5	5	5	5	5
122	4	5	5	5	5
139	5	5	5	5	5
140	5	5	5	5	5
141	5	5	5	5	5
142	5	5	5	5	5
145	5	5	5	5	5
146	5	5	5	5	5
147	5	5	5	5	5
148	5	5	5	5	5
149	4	5	5	5	5
140	5	5	5	5	5
151	5	5	5	5	5
152	5	5	5	5	4
153	5	5	5	5	5
156	5	5	5	5	5
比較A	0	0	4	2	4
比較B	0	0	4	3	4

试验例6(旱地土壤处理的作物选择性试验)

在600cm²的塑料盆中填充旱地土壤，播种大豆(Gl)、ノアサガオ(Ip)、苍耳(Xa)的种子。第二天，将按制剂例1调制的可湿性粉剂用水稀释至设定的有效成分含量(ai,g/10a)，用小型喷雾器均匀地撒布在土壤表面上，每10公亩100升稀释液。然后在温室内培育，在处理后的第21天、按表5中的标准调查除草效果，结果示于表9中。

表9

化合物编号	药量 gai/10a	除草效果 Ip	除草效果 Xa	药害 Gl
18	25	5	5	0
19	6.3	5	5	0
20	6.3	5	5	0
22	6.3	5	5	0
93	1.6	4	5	0
96	1.6	4	5	0
97	6.3	5	5	0
145	6.3	5	5	0
156	25	5	5	0

试验例7(旱地茎叶处理的作物选择性试验)

在600cm²的塑料盆中填充旱地土壤、播种大豆(Gl)、ノアサガオ(Ip)、苍耳(Xa)的种子，在温室内培育2周后，将按制剂例1调制的可湿性粉剂用水稀释至设定的有效成分量(ai, g/10a)，用小型喷雾器从植物体上方喷撒到所有茎叶上，每10公亩100升稀释液，然后在温室内培育，在处理后的第14天，按表5的标准调查除草效果，结果示于表10中。

表10

化合物编号	药量 gai/10a	除草效果 Ip	除草效果 Xa	药害 Gl
20	6.3	5	5	0
22	6.3	5	5	1
97	1.6	5	5	1
104	1.6	4	5	1
145	6.3	5	5	0
156	1.6	5	5	0