

(12) 按照专利合作条约所公布的国际申请

(19) 世界知识产权组织
国际局



(43) 国际公布日
2012年3月22日 (22.03.2012)

PCT

(10) 国际公布号
WO 2012/034403 A1

- (51) 国际专利分类号:
C07D 401/04 (2006.01) C07D 413/12 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01) A01N 43/56 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01) A01P 7/04 (2006.01)
C07D 231/22 (2006.01) A01P 7/02 (2006.01)
- (21) 国际申请号: PCT/CN2011/073810
- (22) 国际申请日: 2011年5月9日 (09.05.2011)
- (25) 申请语言: 中文
- (26) 公布语言: 中文
- (30) 优先权:
201010280882.3 2010年9月14日 (14.09.2010) CN
- (71) 申请人 (对除美国外的所有指定国): 中化蓝天集团有限公司 (SINOCHEM LANTIAN CO., LTD.) [CN/CN]; 中国浙江省杭州市滨江区江南大道96号中化大厦, Zhejiang 310051 (CN)。浙江省化工研究院有限公司 (ZHEJIANG RESEARCH INSTITUTE OF CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.) [CN/CN]; 中国浙江省杭州市天目山路387号, Zhejiang 310023 (CN)。
- (72) 发明人: 及
- (75) 发明人/申请人 (仅对美国): 窦花妮 (DOU, Huani) [CN/CN]; 中国浙江省杭州市天目山路387号, Zhejiang 310023 (CN)。陈杰 (CHEN, Jie) [CN/CN]; 中国浙江省杭州市天目山路387号, Zhejiang 310023 (CN)。郑昀红 (ZHENG, Yunhong) [CN/CN]; 中国

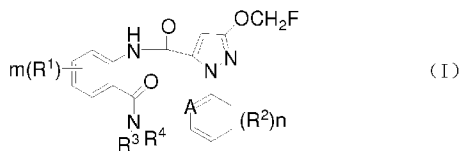
浙江省杭州市天目山路387号, Zhejiang 310023 (CN)。许天明 (XU, Tianming) [CN/CN]; 中国浙江省杭州市天目山路387号, Zhejiang 310023 (CN)。邢家华 (XING, Jiahua) [CN/CN]; 中国浙江省杭州市天目山路387号, Zhejiang 310023 (CN)。郑志文 (ZHENG, Zhiwen) [CN/CN]; 中国浙江省杭州市天目山路387号, Zhejiang 310023 (CN)。彭伟立 (PENG, Weili) [CN/CN]; 中国浙江省杭州市天目山路387号, Zhejiang 310023 (CN)。许勇华 (XU, Yonghua) [CN/CN]; 中国浙江省杭州市天目山路387号, Zhejiang 310023 (CN)。董德臻 (DONG, Dezhen) [CN/CN]; 中国浙江省杭州市天目山路387号, Zhejiang 310023 (CN)。魏优昌 (WEI, Youchang) [CN/CN]; 中国浙江省杭州市天目山路387号, Zhejiang 310023 (CN)。孔小林 (KONG, Xiaolin) [CN/CN]; 中国浙江省杭州市天目山路387号, Zhejiang 310023 (CN)。袁静 (YUAN, Jin) [CN/CN]; 中国浙江省杭州市天目山路387号, Zhejiang 310023 (CN)。刘刚 (LIU, Gang) [CN/CN]; 中国浙江省杭州市天目山路387号, Zhejiang 310023 (CN)。

- (74) 代理人: 浙江杭州金通专利事务所有限公司 (ZHEJIANG HANGZHOU JINTONG PATENT AGENCY CO., LTD.); 中国浙江省杭州武林广场省科协大楼19层, Zhejiang 310003 (CN)。
- (81) 指定国 (除另有指明, 要求每一种可提供的国家保护): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB,

[见续页]

(54) Title: FLUOROMETHOXYPIRAZOLE ANTHRANILAMIDE COMPOUNDS, SYNTHESIZATION METHODS AND USES THEREOF

(54) 发明名称: 一种含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物、其合成方法及应用



(57) Abstract: Fluoromethoxypyrazole anthranilamide compounds of formula (I) or agrochemical salts thereof, as well as synthesis methods and uses thereof. The compounds of formula (I) have broad-spectrum insecticidal activities and are effective to pests of lepidopteron (such as *Plutella xylostella*), hemipteran (such as *Aphis medicaginis*), homopteran (such as *Nilaoarvata lugens*) and the like. Agricultural preparations including compounds of formula (I) and methods of preventing and controlling pests are involved.

(57) 摘要:

一种如式 (I) 所示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物或其农业上适用的盐, 以及其合成方法和用途。式 (I) 化合物具有广谱杀虫活性, 可杀灭鳞翅目 (如小菜蛾)、半翅目 (如苜蓿蚜)、同翅目 (如水稻褐飞虱) 等害虫。以及一种含有式 (I) 化合物的农药制剂和一种防治有害生物的方法。

WO 2012/034403 A1



BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW。

- (84) **指定国** (除另有指明, 要求每一种可提供的地区保护): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ,

BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧洲 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)。

根据细则 4.17 的声明:

- 发明人资格(细则 4.17(iv))

本国际公布:

- 包括国际检索报告(条约第 21 条(3))。

说明书

一种含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物、其合成方法及应用

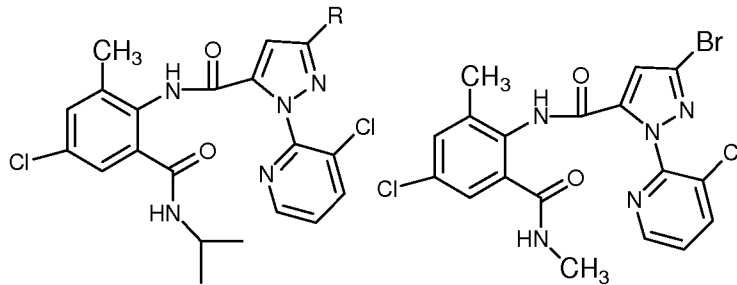
技术领域

本发明提供了一种邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物。

背景技术

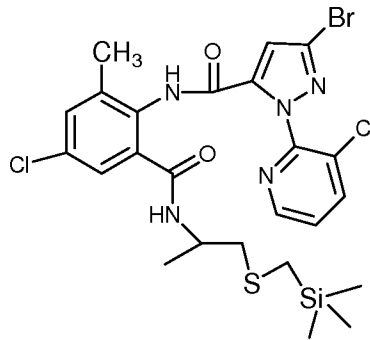
邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物（鱼尼丁受体抑制剂类）是近几年开发的防治无脊椎动物害虫的有效杀虫剂。

PCT 专利申请 WO2003/015519 公开了如下具有杀虫活性的化合物：

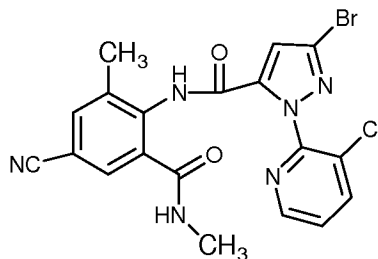


R=CF₃,Cl,Br 或 OCH₂CF₃

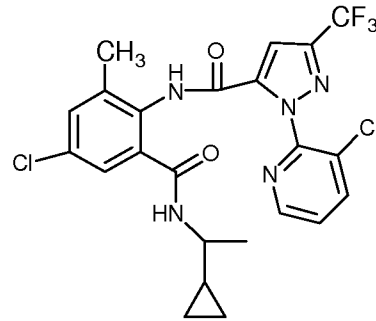
PCT 专利申请 WO2004/033468 公开了如下具有杀虫活性的化合物：



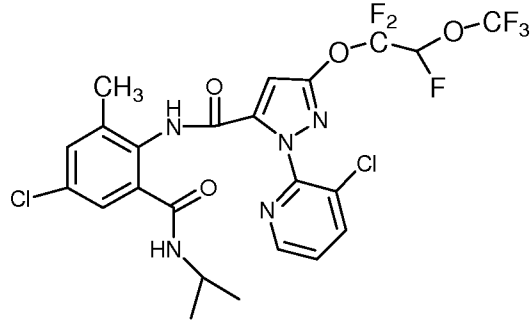
PCT 专利申请 WO2004/067528 公开了如下具有杀虫活性的化合物：



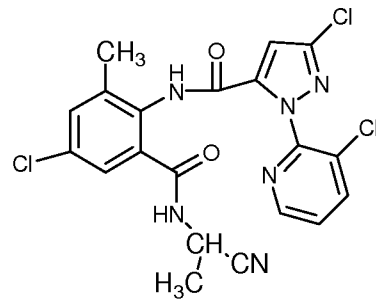
PCT 专利申请 WO2006/080311 公开了如下具有杀虫活性的化合物：



PCT 专利申请 WO2006/023783 公开了如下具有杀虫活性的化合物：



PCT 专利申请 WO2008/134969 公开了如下具有杀虫活性的化合物：



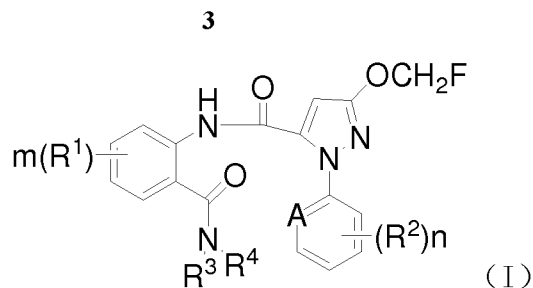
上述 PCT 专利申请中所有公开的化合物虽与本发明所述化合物有一定的相似之处，但都没有记载具有相当于本发明所述式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物。尽管用于防治无脊椎害虫的许多产品可以购买，但仍然需要更有效、低毒、低成本、对环境安全的新化合物。

发明内容

本发明的目的在于提供一种新的有害生物防除剂，可防除在农业园艺领域中成为问题的各种有害生物，或寄生于动物的有害生物，在低药量下具有对有害生物超高的防治效果。

为实现上述目的，本发明提供如下技术手段：

一种结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物或其农业上适用的盐，



其中：

A 为 N 或 CH；

R¹ 为氢、卤素、氰基、硝基、烷基、卤代烷基、氰基烷基、链烯基、卤代链烯基、炔基、卤代炔基、烷氧基、氰基烷氧基、卤代烷氧基、烷硫基、卤代烷硫基、烷基磺酰基、烷基羰基、卤代烷基羰基、烷氧基羰基、卤代烷氧基羰基或氨基烷基；

R² 为氢、卤素、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基或氰基；

R³ 为氢、烷基或烷氧基；

R⁴ 为氢、氰基、烷基、烷氧基、烷氨基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代烷氨基、氰基烷基、环烷基、卤代环烷基、羟烷基、烷氧羰基甲基、烷氧基酰胺基、烷基酰胺基、卤代烷基酰胺基、氰基取代的烷基酰胺基或芳杂环甲基；

或者 R³ 和 R⁴ 与所连接的 N 一起形成三元、四元、五元或六元环；

m 为 0~4 的整数；

n 为 0~4 的整数。

作为优选的方式，结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物中：

R¹ 为氢、卤素、氰基、硝基、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基、氰基 C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 卤代链烯基、C₂-C₆ 炔基、卤代 C₃-C₆ 炔基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 氰基烷氧基、C₁-C₆ 卤代烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 卤代烷硫基、C₁-C₆ 烷基磺酰基、C₁-C₆ 烷基羰基、卤代 C₁-C₆ 烷基羰基、C₁-C₆ 烷氧基羰基、卤代 C₁-C₆ 烷氧基羰基或氨基 C₁-C₆ 烷基；

R² 为氢、卤素、C₁-C₆ 烷基、卤代 C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基、卤代 C₁-C₆ 烷氧基或氰基；

R³ 为氢或 C₁-C₃ 烷基；

R⁴ 为氢、氰基、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 烷氨基、卤代 C₁-C₆ 烷基、卤代 C₁-C₆ 烷氧基、卤代 C₁-C₆ 烷氨基、氰基 C₁-C₆ 烷基、C₃-C₆ 环烷基、卤代 C₃-C₆ 环烷基、羟 C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷氧羰基甲基、C₁-C₆ 烷氧基酰胺基、C₁-C₆ 烷基酰胺基、卤代 C₁-C₆ 烷基酰胺基、氰基取代的 C₁-C₆ 烷基酰胺基或芳杂环甲基；

m 为 2；

n 为 1。

作为进一步优选的方式，结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰胺氨基苯甲酰胺类化合物中：

A 为 N；

R¹ 为氢、卤素、氰基、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基或 C₁-C₆ 烷基羰基；

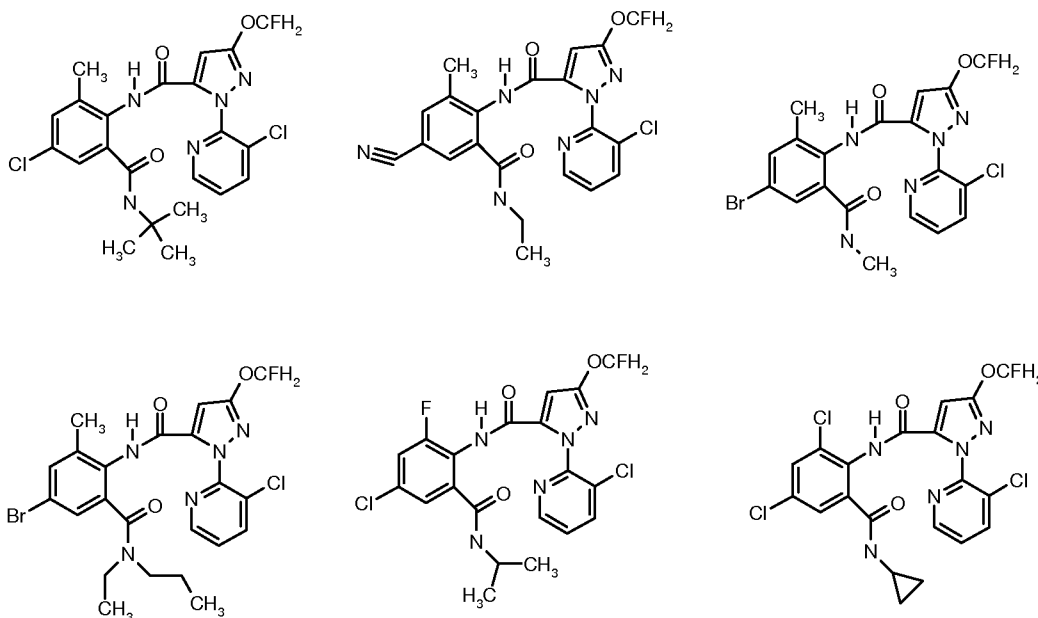
R² 为卤素、氰基、C₁-C₆ 烷基或卤代 C₁-C₃ 烷基。

作为更进一步优选的方式，结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰胺氨基苯甲酰胺类化合物中：

R¹ 为氢、卤素、氰基、甲基或三氟甲基；

R² 为卤素或氰基。

作为最为优选的方式，结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰胺氨基苯甲酰胺类化合物为以下结构式所示化合物：



在上述 A、R¹、R²、R³、R⁴ 和 R⁵ 基团中：

作为 R¹、R² 或 R⁴ 中的卤素或作为取代基的卤素，可列举出，氟、氯、溴或碘的各原子。作为取代基的卤素的数可以为 1 或 2 以上，在 2 以上的场合，各卤素可以相同也可以不同。另外，卤素的取代位置可以在任一位置。

R¹、R²、R³ 或 R⁴ 中的烷基或烷基部分，可以是直链也可以是支链。作为其具体例，可列举出，甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、叔丁基、戊基、己基这样的 C₁₋₆ 的烷基等。

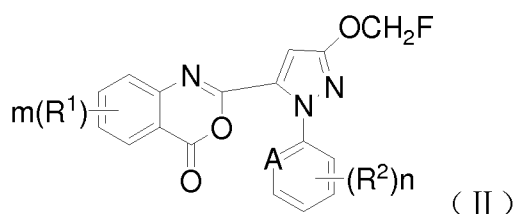
R¹ 中的链烯基或链烯基部分，可以是直链或支链的任一种。作为其具体例，可列举出，乙烯基、1-丙烯基、烯丙基、异丙烯基、1-丁烯基、1, 3-丁二烯基、1-己烯基这样的 C₂₋₆ 的

链烯基等。

R^1 中的炔基或炔基部分，可以是直链或支链的任一种。作为其具体例，可列举出乙炔基、2-丁炔基、2-戊炔基、3-己炔基这样的 C_{2-6} 的炔基等。

在上述结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物中，有时存在光学异构体、几何异构体这样的异构体，本发明包含各异构体及异构体混合物这两者情况。此外，在该技术领域的技术常识的范围内，本发明也包含上述以外的各种异构体。另外，虽然有时因异构体的种类导致形成与上述结构式 (I) 不同的化学结构的情况，但只要是本领域技术人员就能充分认识这是存在异构体的关系，因此很明显是在本发明的范围内。

本发明还提供一种用于制备上述结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物，具有以下结构式 (II)：



其中 A、 R^1 和 R^2 基团及 m 和 n 与结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物中基团相对应，即：

A 为 N 或 CH；

R^1 为氢、卤素、氰基、硝基、烷基、卤代烷基、氰基烷基、链烯基、卤代链烯基、炔基、卤代炔基、烷氧基、氰基烷氧基、卤代烷氧基、烷硫基、卤代烷硫基、烷基磺酰基、烷基羰基、卤代烷基羰基、烷氧基羰基、卤代烷氧基羰基或氨基烷基；

R^2 为氢、卤素、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基或氰基；

m 为 0~4 的整数；

n 为 0~4 的整数。

作为优选的方式，结构式 (II) 表示的化合物中：

A 为 N；

R^1 为氢、卤素、氰基、硝基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、氰基 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 链烯基、 C_2-C_6 卤代链烯基、 C_2-C_6 炔基、卤代 C_3-C_6 炔基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 氰基烷氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 卤代烷硫基、 C_1-C_6 烷基磺酰基、 C_1-C_6 烷基羰基、卤代 C_1-C_6 烷基羰基、 C_1-C_6 烷氧基羰基、卤代 C_1-C_6 烷氧基羰基或氨基 C_1-C_6 烷基；

R^2 为氢、卤素、 C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、卤代 C_1-C_6 烷氧基或氰基；

m 为 2；

n 为 1。

作为进一步优选的方式，结构式 (II) 表示的化合物中：

R¹ 为氢、卤素、氰基、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基或 C₁-C₆ 烷基羰基；

R² 为卤素、氰基、C₁-C₆ 烷基或卤代 C₁-C₃ 烷基。

作为更为优选的方式，结构式 (II) 表示的化合物中：

R¹ 为氢、卤素、氰基、甲基或三氟甲基；

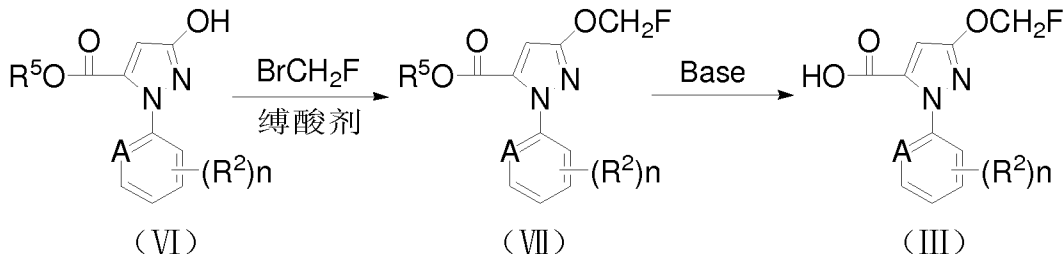
R² 为卤素或氰基。

本发明还提供上述结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰胺氨基苯甲酰胺类化合物的合成方法。

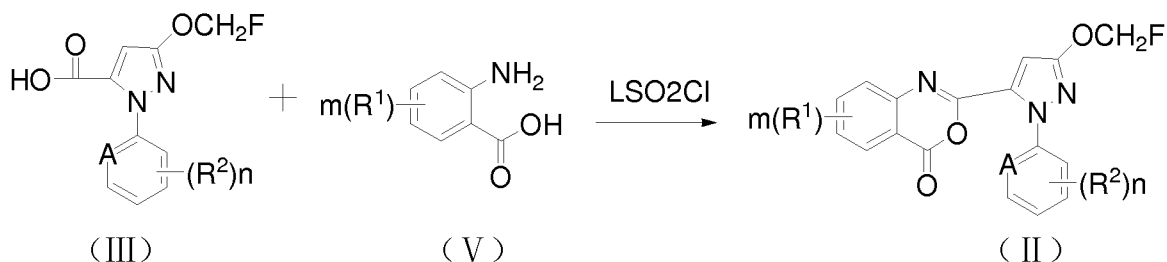
一种结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰胺氨基苯甲酰胺类化合物合成方法，包括如下步骤：

(1) 在非质子性溶剂中，结构式 (VI) 表示的化合物与一氟一溴甲烷在缚酸剂作用下，反应得到结构式 (VII) 表示化合物；

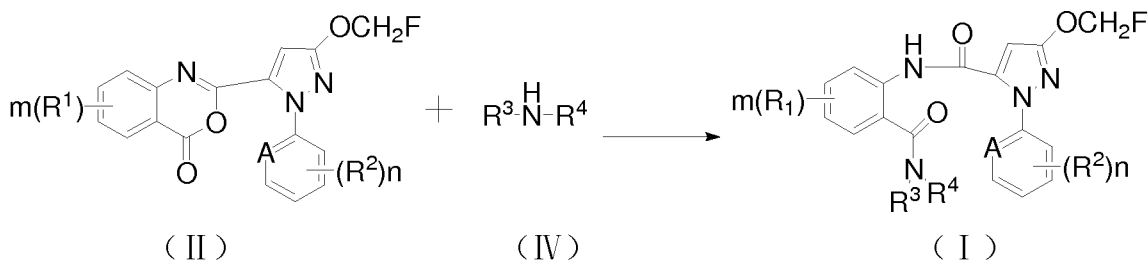
(2) 在质子性溶剂中，结构式 (VII) 表示化合物在碱作用下水解得到结构式 (III) 表示的含一氟甲氧基吡唑羧酸；



(3) 在非质子性溶剂中，加入碱和烷基磺酰氯，结构式 (III) 表示的含一氟甲氧基吡唑羧酸和结构式 (V) 表示的取代邻氨基苯甲酸反应得结构式 (II) 表示的含一氟甲氧基吡唑的 4H-苯并[1,3]噁嗪-4-酮类化合物；



(4) 在非质子性溶剂中，结构式 (II) 表示的含一氟甲氧基吡唑的 4H-苯并[1,3]噁嗪-4-酮类化合物和结构式 (IV) 表示的化合物反应得结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰胺氨基苯甲酰胺类化合物；



结构式 (II) 至 (VII) 表示的化合物中 A、R¹、R²、R³、R⁴ 和 R⁵ 基团以及 m 和 n 的定义及优选方式如上述结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰胺氨基苯甲酰胺类化合物，其中结构式 (VI) 表示的化合物中 R⁵ 为 C₁₋₆ 烷基。

上述结构式 (VI) 表示的化合物为公知化合物，其制备方法可以参照 PCT 专利申请 WO03015519 和 WO2006023783。

作为优选的实施方式，前述合成方法步骤 (1) 中，结构式 (VI) 表示的化合物与一氟一溴甲烷和缚酸剂的投料物质的量比为 1: 1.1~2: 1.1~2，进一步优选 1: 1.1~1.5: 1.1~1.5；所述非质子性溶剂选自四氢呋喃、乙腈、1, 4-二氧六环或丙酮中的一种或两种以上组合；反应温度为 10~90°C，进一步优选 20~80°C。

步骤 (1) 结构式 (VII) 表示的化合物的后处理是：过滤，滤饼用少量的有机溶剂进行淋洗，滤液合并，浓缩。不必进行分离纯化直接进行步骤 (2) 所述水解反应。

作为优选的实施方式，前述合成方法步骤 (2) 中，结构式 (VII) 表示化合物与碱的投料物质的量比为 1: 1~1.5，进一步优选 1: 1~1.2；所述质子性溶剂为甲醇和/或乙醇；反应温度为 10~90°C，进一步优选 20~80°C。

步骤 (2) 中结构式 (III) 表示的含一氟甲氧基吡唑羧酸的后处理是：蒸除有机溶剂后，加水，用乙醚进行萃取，然后水相中加稀盐酸使呈酸性，大量固体析出，过滤，水洗，红外灯干燥，得所述结构式 (III) 表示含一氟甲氧基吡唑羧酸固体。

作为优选的实施方式，前述合成方法步骤 (3) 中，结构式 (III) 表示的含一氟甲氧基吡唑羧酸和结构式 (V) 表示的取代邻氨基苯甲酸及烷基磺酰氯的投料物质的量比为 1: 1~1.5: 2~3，进一步优选 1: 1~1.2: 2~2.5；所述烷基磺酰氯为甲基磺酰氯；所述非质子性溶剂选自四氢呋喃、乙腈、1, 4-二氧六环、乙醚或甲苯中的一种或两种以上组合；所述碱为有机碱，有机碱进一步优选自三乙胺、吡啶或 3-甲基吡啶中的一种或两种以上组合；反应温度为 -30~80°C，进一步优选 -15~30°C。其中有机碱的体积用量为结构式 (III) 表示的含一氟甲氧基吡唑羧酸质量的 1~4 倍 (ml/g)，优选为 1~2 倍 (ml/g)。

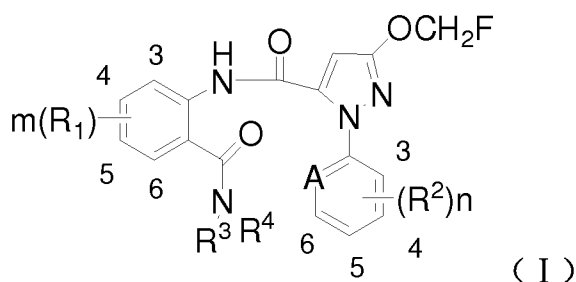
步骤 (3) 的后处理为：反应结束，过滤，滤饼先后用水、有机溶剂与水的混合溶剂及少量有机溶剂洗后得第一批固体；滤液蒸除溶剂后，加有机溶剂萃取，无水硫酸钠干燥后，过

滤，浓缩，用乙醇进行重结晶，得第二批固体；两批固体合并，得所述结构式 (II) 表示的化合物。

其中结构式 (V) 表示的取代邻氨基苯甲酸是一种已知化合物，可以通过许多方法进行制备，可参照以下文献：Organic Synthesis, Coll.Vol.79,p196(2002)； Vol.10,p23(2004)； Adv.Heterocycl.Chem.1975,18,1-58； Journal of the Brazilian Chemical Society 2001,12(3),273-324； Angew.Chem.Int.Ed.Engl.1980,19,222-223。

作为优选的实施方式，前述合成方法步骤 (4) 中，结构式 (II) 表示的含一氟甲氧基吡唑的 4H-苯并[1,3]噁嗪-4-酮类化合物和结构式 (IV) 表示的化合物的投料物质的量比为 1: 1~5，进一步优选 1: 1~2；所述非质子性溶剂选自四氢呋喃、乙腈、1,4-二氧六环、乙醚、甲苯、二氯甲烷或氯仿中的一种或两种以上组合。其中非质子性溶剂的体积用量为结构式 (II) 表示的含一氟甲氧基吡唑的 4H-苯并[1,3]噁嗪-4-酮类化合物质量的 5~60 倍 (ml/g)，优选为 5~20 倍 (ml/g)。

下面，将本发明所涉及的典型化合物列于索引表 1。



以下的索引表 1 中采用的缩写如下：t 是叔、n 是正、i 是异、s 是仲、Me 是甲基、Et 是乙基、Pr 是丙基、Bu 是丁基；相应的 i-Pr 是异丙基等。索引表 1 中 $R^2=3-C1$ ， $n=1$ ， R^3 和 R^4 可以为独立的取代基，也可以连接成一个整体。

索引表 1

编号	A	R^1	R^3	R^4
1	N	3-CH ₃ , 5-C1	H	n-C ₃ H ₇
2	N	3-CH ₃ , 5-C1	H	i-C ₃ H ₇
3 (实施例 2)	N	3-CH ₃ , 5-C1	H	Methyl
4	N	3-CH ₃ , 5-C1	H	Ethyl
5	N	3-CH ₃ , 5-C1	H	n-C ₄ H ₉
6	N	3-CH ₃ , 5-C1	H	Cyclohexyl

7	N	3-CH ₃ , 5-Cl	H	Furan-2-yl-methyl
8 (实施例 1)	N	3-CH ₃ , 5-Cl	H	t-C ₄ H ₉
9	N	3-CH ₃ , 5-Cl	H	n-C ₅ H ₁₁
10	N	3-CH ₃ , 5-Cl	Ethyl	n-C ₃ H ₇
11	N	3-CH ₃ , 5-Cl	H	CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅
12	N	3-CH ₃ , 5-Cl	(CH ₂) ₄	
13	N	3-CH ₃ , 5-Cl	Methyl	Methyl
14	N	3-CH ₃ , 5-Cl	Ethyl	Ethyl
15	N	3-CH ₃ , 5-Cl	(CH ₂ CH ₂) ₂ O	
16	N	3-CH ₃ , 5-Cl	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
17	N	3-CH ₃ , 5-Cl	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃
18	N	3-CH ₃ , 5-Cl	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃
19	N	3-CH ₃ , 5-Cl	(CH ₂) ₄ CH(CH ₃)	
20	N	3-CH ₃ , 5-Cl	Ethyl	n-C ₄ H ₉
21	N	3-CH ₃ , 5-Cl	(CH ₃) ₃ CCH(CH ₂ CH ₂) ₂	
22	N	3-CH ₃ , 5-Cl	(CH ₂) ₅	
23	N	3-CH ₃ , 5-Cl	(CH ₂) ₄ CH(CH ₂ CH ₃)	
24	N	3-CH ₃ , 5-Cl	H	O(CH ₂) ₃ CH ₃
25	N	3-CH ₃ , 5-Cl	H	OCH ₃
26	N	3-CH ₃ , 5-Cl	H	OCH ₂ CH ₃
27	N	3-CH ₃ , 5-Cl	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
28	N	3-CH ₃ , 5-Cl	H	NHCH ₃
29	N	3-CH ₃ , 5-Cl	H	NHC(CH ₃) ₃
30	N	3-CH ₃ , 5-Cl	H	2-Methyl-cyclohexyl
31	N	3-CH ₃ , 5-Cl	H	Cyclopropane
32	N	3-Cl, 5-Cl	H	Cyclopropane
33 (实施例 3)	N	3-CH ₃ , 5-CN	H	Ethyl
34	N	3-CH ₃ , 5-CN	H	n-C ₃ H ₇
35	N	3-CH ₃ , 5-CN	H	n-C ₄ H ₉
36	N	3-CH ₃ , 5-CN	H	Methyl

37	N	3-CH ₃ , 5-CN	(CH ₂ CH ₂) ₂ O	
38	N	3-CH ₃ , 5-CN	Ethyl	n-C ₃ H ₇
39	N	3-CH ₃ , 5-Br	H	n-C ₃ H ₇
40	N	3-CH ₃ , 5-Cl	(CH ₂ CH(CH ₃)) ₂ CH ₂	
41	N	3-CH ₃ , 5-Cl	(CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃)) ₂ CH ₂	
42	N	3-CH ₃ , 5-CN	Methyl	Methyl
43	N	3-CH ₃ , 5-CN	H	2-Methyl-cyclohexyl
44	N	3-CH ₃ , 5-CN	H	cyclohexyl
45	N	3-CH ₃ , 5-CN	H	n-C ₅ H ₁₁
46	N	3-CH ₃ , 5-CN	H	t-C ₄ H ₉
47	N	3-CH ₃ , 5-CN	H	Furan-2-yl-methyl
48	N	3-CH ₃ , 5-CN	(CH ₂) ₅	
49	N	3-CH ₃ , 5-Br	Ethyl	n-C ₃ H ₇
50	N	3-CH ₃ , 5-Br	H	cyclohexyl
51	N	3-CH ₃ , 5-Br	H	Methyl
52	N	3-CH ₃ , 5-CN	Ethyl	Ethyl
53	N	3-CH ₃ , 5-CN	H	OCH ₃
54	N	3-CH ₃ , 5-CN	(CH ₂) ₄	
55	N	3-CH ₃ , 5-Br	H	n-C ₄ H ₉
56	N	3-CH ₃ , 5-Br	Methyl	Methyl
57	N	3-CH ₃ , 5-Br	H	t-C ₄ H ₉
58	N	3-CH ₃ , 5-Br	H	i-C ₃ H ₇
59	N	3-CH ₃ , 5-Br	H	Ethyl
60	N	3-CH ₃ , 5-Br	H	n-C ₅ H ₁₁
61	N	3-CH ₃ , 5-Br	H	2-Methyl-cyclohexyl
62	N	3-CH ₃ , 5-Br	Ethyl	Ethyl
63	N	3-CH ₃ , 5-Br	(CH ₂) ₄	
64	N	3-CH ₃ , 5-Br	H	Furan-2-yl-methyl
65	N	3-CH ₃ , 5-Br	H	OCH ₃
66	N	3-CH ₃ , 5-Br	H	OC ₂ H ₅

67	N	3-CH ₃ , 5-Br	H	OC ₄ H ₉ -n
68	N	3-CH ₃ , 5-Br	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃
69	N	3-CH ₃ , 5-Br	H	CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅
70	N	3-CH ₃ , 5-Br	(CH ₂ CH ₂) ₂ O	
71	N	3-CH ₃ , 5-Br	(CH ₂) ₅	
72	N	3-CH ₃ , 5-Br	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₄	
73	N	3-CH ₃ , 5-Br	(CH ₂ CH ₂) ₂ CH(t-C ₄ H ₉)	CH ₂ CH ₂ OH
74	N	3-CH ₃ , 5-Br	H	NHCH ₃
75	N	3-CH ₃	H	Methyl
76	N	3-CH ₃	H	Ethyl
77	N	3-CH ₃	H	t-C ₄ H ₉
78	N	3-CH ₃	(CH ₂ CH ₂) ₂ O	
79	N	3-CH ₃	H	Cyclopropane
80	N	3-CH ₃ , 5-Br	H	Cyclopropane
81	N	H	H	Cyclopropane
82	N	3-CH ₃ , 4-Cl	H	Cyclopropane
83	N	3-CH ₃ , 5-I	H	Cyclopropane
84	N	3-CH ₃ , 5-CN	H	CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅
85	N	3-CH ₃ , 5-I	H	t-C ₄ H ₉
86	N	3-CH ₃ , 5-NO ₂	H	t-C ₄ H ₉
87	N	H	H	t-C ₄ H ₉
88	N	3-CH ₃ , 4-Cl	H	t-C ₄ H ₉
89	N	3-Cl, 5-Cl	H	t-C ₄ H ₉
90	N	H	H	cyclohexyl
91	N	3-CH ₃ , 5-I	H	cyclohexyl
92	N	3-CH ₃ , 4-Cl	H	cyclohexyl
93	N	3-Cl, 5-Cl	H	cyclohexyl
94	N	H	H	Methyl
95	N	3-CH ₃ , 5-I	H	Methyl
96	N	3-CH ₃ , 4-Cl	H	Methyl

97	N	3-Cl, 5-Cl	H	Methyl
98	N	H	Methyl	Methyl
99	N	3-CH ₃ , 5-I	Methyl	Methyl
100	N	3-Cl, 5-Cl	Methyl	Methyl
101	N	3-Cl, 5-Cl	H	Cyclopropane
102	N	3-Cl, 5-Cl	Methyl	OCH ₃
103	N	3-Cl, 5-Cl	H	Ethyl
104	N	3-Cl, 5-Cl	H	i-C ₃ H ₇
105	N	3-Cl, 5-Cl	H	n-C ₃ H ₇
106	N	3-Cl, 5-Cl	Ethyl	n-C ₃ H ₇
107	N	3-Cl, 5-Cl	H	Furan-2-yl-methyl
108	N	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅
109	N	3-Cl, 5-Cl	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
110	N	3-CH ₃ , 5-CN	H	Cyclopropane
111	N	3-CH ₃ , 5-I	H	i-C ₃ H ₇
112	N	3-CH ₃ , 5-I	H	Ethyl
113	N	3-CH ₃ , 5-I	H	n-C ₃ H ₇
114	N	3-CH ₃ , 4-Cl	Methyl	Methyl
115	N	3-CH ₃ , 4-Cl	Methyl	OCH ₃
116	N	3-CH ₃ , 5-Br	H	CH ₂ CH ₂ OH
117	N	H	H	CH ₂ CN
118	N	3-F, 5-Cl	H	Methyl
119	N	3-F, 5-Cl	H	Ethyl
120	N	3-F, 5-Cl	H	n-C ₃ H ₇
121	N	3-F, 5-Cl	H	i-C ₃ H ₇
122	N	3-F, 5-Cl	H	(CH ₂) ₃ CH ₃
123	N	3-F, 5-Cl	H	t-C ₄ H ₉
124	N	3-F, 5-Cl	H	Cyclopropane
125	N	3-F, 5-Cl	Methyl	Methyl
126	N	3-F, 5-Cl	Methyl	OCH ₃

127	N	3-F, 5-Cl	H	2-Methyl-cyclohexyl
128	N	3-F, 5-Cl	H	cyclohexyl
129	N	3-F, 5-Cl	H	CH ₂ CN
130	N	3-CF ₃ , 5-Cl	H	Methyl
131	N	3-CF ₃ , 5-Cl	H	Ethyl
132	N	3-CF ₃ , 5-Cl	H	n-C ₃ H ₇
133	N	3-CF ₃ , 5-Cl	H	i-C ₃ H ₇
134	N	3-CF ₃ , 5-Cl	H	n-C ₄ H ₉
135	N	3-CF ₃ , 5-Cl	H	t-C ₄ H ₉
136	N	3-CH ₃	H	n-C ₃ H ₇
137	N	3-CH ₃	Methyl	Methyl
138	N	3-CH ₃	(CH ₂) ₄	
139	N	3-CH ₃	(CH ₂) ₅	
140	N	3-CH ₃	CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂) ₄	
141	N	3-CH ₃	(CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃)) ₂ CH ₂	
142	N	3-F, 5-Cl	(CH ₂ CH ₂) ₂ O	
143	N	3-F, 5-Cl	(CH ₂) ₅	
144	N	3-F, 5-Cl	(CH ₂) ₄	
145	N	3-F, 5-Cl	H	CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃
146	N	3-F, 5-Cl	H	Furan-2-yl-methyl
147	N	3-F, 5-Cl	Ethyl	n-C ₃ H ₇
148	N	3-F, 5-Cl	Ethyl	n-C ₄ H ₉
149	N	3-F, 5-Cl	H	n-C ₅ H ₁₁
150	N	3-F, 5-Cl	H	NHCH ₃
151	N	3-CF ₃ , 5-Cl	(CH ₂ CH ₂) ₂ O	
152	N	3-CF ₃ , 5-Cl	(CH ₂) ₅	
153	N	3-CF ₃ , 5-Cl	(CH ₂) ₄	
154	N	3-CF ₃ , 5-Cl	H	cyclohexyl
155	N	3-CF ₃ , 5-Cl	H	CH ₂ CN
156	N	3-CF ₃ , 5-Cl	H	Cyclopropyl

157	N	3-CF ₃ , 5-Cl	Methyl	Methyl
158	N	3-CF ₃ , 5-Cl	Methyl	OCH ₃
159	N	3-CF ₃ , 5-Cl	H	CH ₃ NH
160	N	3-F	H	CH ₂ CN
161	N	3-F	H	Methyl
162	N	3-F	H	Ethyl
163	N	3-F	H	t-C ₄ H ₉
164	N	3-F	Methyl	Methyl
165	N	3-F	Methyl	OCH ₃
166	N	3-F	H	NHCH ₃
167	N	3-F	H	NHC(CH ₃) ₃
168	N	3-F	H	Furan-2-yl-methyl
169	N	3-F	(CH ₂ CH ₂) ₂ O	
170	N	3-F	(CH ₂) ₅	
171	N	3-F	(CH ₂) ₄	
172	N	3-CF ₃	(CH ₂ CH ₂) ₂ O	
173	N	3-CF ₃	(CH ₂) ₅	
174	N	3-CF ₃	(CH ₂) ₄	
175	N	3-Cl, 5-Cl	Ethyl	n-C ₄ H ₉
176	N	3-Cl, 5-Cl	H	2-Methyl-Cyclohexyl
177	N	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CN
178	N	3-Cl, 5-Cl	H	n-C ₅ H ₁₁
179	N	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₃ NH
180	N	3-Cl, 5-Cl	Methyl	CH ₃ O
181	N	3-Cl, 6-Cl	(CH ₂ CH ₂) ₂ O	
182	N	3-Cl, 6-Cl	H	Methyl
183	N	3-Cl, 6-Cl	H	Ethyl
184	N	3-Cl, 6-Cl	H	n-C ₃ H ₇
185	N	3-Cl, 6-Cl	H	i-C ₃ H ₇
186	N	3-Cl, 6-Cl	H	n-C ₄ H ₉

187	N	3-C1, 6-C1	H	t-C ₄ H ₉
188	N	3-C1, 6-C1	H	Cyclopropyl
189	N	3-C1, 6-C1	H	n-C ₅ H ₁₁
190	N	3-C1, 6-C1	H	2-Methyl-Cyclohexyl
200	N	3-C1, 6-C1	H	Cyclohexyl
201	N	3-C1, 6-C1	Ethyl	n- C ₃ H ₇
202	N	3-C1, 6-C1	Ethyl	n- C ₄ H ₉
203	N	3-C1, 6-C1	Methyl	Methyl
204	N	3-C1, 6-C1	(CH ₂) ₅	
205	N	3-C1, 4-C1	Ethyl	n- C ₃ H ₇
206	N	3-C1, 4-C1	H	Cyclohexyl
207	N	3-C1, 4-C1	H	2-Methyl-Cyclohexyl
208	N	3-C1, 4-C1	H	n-C ₅ H ₁₁
209	N	3-C1, 4-C1	H	Cyclopropyl
210	N	3-C1, 4-C1	H	t-C ₄ H ₉
211	N	3-C1, 4-C1	H	n-C ₄ H ₉
212	N	3-C1, 4-C1	H	n-C ₃ H ₇
213	N	3-C1, 4-C1	H	i-C ₃ H ₇
214	N	3-C1, 4-C1	H	Methyl
215	N	3-C1, 4-C1	H	Ethyl
216	N	3-C1, 4-C1	H	n-C ₃ H ₇
217	N	3-C1, 4-C1	Methyl	Methyl
218	N	3-C1, 4-C1	(CH ₂) ₅	
219	N	3-C1, 4-C1	H	CH ₂ CN
220	CH	3-CH ₃ , 5-C1	H	Methyl
221	CH	3-CH ₃ , 5-C1	H	t- C ₄ H ₉
222	CH	3-C1, 5-C1	H	Methyl
223	CH	3-C1, 5-C1	H	t- C ₄ H ₉
224	CH	3-F, 5-C1	H	Methyl
225	CH	3-F, 5-C1	H	t- C ₄ H ₉

226	CH	3-CF ₃ , 5-Cl	H	Methyl
227	CH	3-CF ₃ , 5-Cl	H	t- C ₄ H ₉

以下索引表 2 为索引表 1 所述部分化合物的物化性能及核磁数据。

注:索引表 2 所述的编号与索引表 1 所述的化合物编号相对应。其中 s 为单峰, d 为双峰, t 为三重峰, q 为四重峰, m 为多重峰, brs 为宽单峰。

索引表 2

编号	熔点/°C	¹ HNMR(除非另有说明, 试剂均为 CDCl ₃)
1		0.95-0.98(m, 3H), 1.58-1.62(m, 2H), 2.19(s, 3H), 3.32-3.37(m, 2H), 5.83-5.96(d, 2H), 6.12(s, 1H), 6.66(s, 1H), 7.22(s, 1H), 7.33-7.37(m, 1H), 7.82-7.84(d, 1H), 8.45-8.46(d, 1H), 10.00(s, 1H)
2		1.20-1.22(d, 6H), 2.18(s, 3H), 4.15-4.20(m, 1H), 5.83-5.96(d, 2H), 5.92-5.94(d, 1H), 6.71(s, 1H), 7.19-7.36(m, 3H), 7.82-7.84(d, 1H), 8.46(s, 1H), 10.06(s, 1H)
3(实施例 2)	236-237	2.16(s, 3H), 2.67(s, 3H), 5.85-5.99(d, 1H), 6.93(brs, 1H), 7.34(s, 1H), 7.45(s, 1H), 7.54-7.57(m, 1H), 8.10-8.47(m, 3H), 10.18(brs, 1H)
4		1.16-1.20(t, 3H), 2.17(s, 3H), 3.37-3.44(m, 2H), 5.83-5.96(d, 2H), 6.15(s, 1H), 6.75(s, 1H), 7.19-7.36 (m, 3H), 7.82-7.84(d, 1H), 8.44-8.46(m, 1H), 10.00(s, 1H)
5		0.91-0.95(m, 3H), 1.34-1.60(m, 4H), 2.18(s, 3H), 3.34-3.39(m, 2H), 5.82-5.96(d, 2H), 6.12(s, 1H), 6.71(s, 1H), 7.19-7.36(m, 3H), 7.81-7.83(d, 1H), 8.44-8.45(d, 1H), 10.00(s, 1H)
6	252-253	1.14-1.96(m, 10H), 1.59(s, 3H), 2.18(s, 3H), 3.85-3.87 (d, 1H), 5.82-5.96(d, 2H), 5.96(s, 1H), 6.69(s, 1H), 7.19-7.36(m, 3H), 7.81-7.83(d, 1H), 8.44-8.45(d, 1H), 10.03(s, 1H)
7		2.34(s, 3H), 4.54-4.56(d, 2H), 5.83-5.97(d, 2H), 6.28-6.64 (m, 3H), 7.34-7.36(d, 2H), 7.81-7.83(d, 1H), 8.44-8.45(d, 1H), 9.89(s, 1H)

8 (实施例 1)	227-228	DMSO-d ₆ : 1.26 (s, 9H), 2.16 (s, 3H), 5.84-5.97 (d, 2H), 6.93 (s, 1H), 7.26-7.58 (m, 4H), 8.10-8.14 (m, 1H), 8.45-8.46 (d, 1H), 10.10 (s, 1H)
9		0.89-0.90 (m, 3H), 1.33-1.59 (m, 6H), 2.19 (s, 3H), 5.83-5.96 (d, 2H), 6.34 (s, 1H), 6.68 (s, 1H), 7.21-7.37 (m, 2H), 7.82-7.84 (d, 1H), 8.45-8.46 (d, 1H), 10.02 (s, 1H)
10	184-185	0.91-0.96 (m, 3H), 1.37-1.61 (m, 2H), 2.02 (s, 3H), 2.92-3.40 (m, 4H), 5.81-5.94 (d, 2H), 6.94-7.34 (m, 4H), 7.80-7.82 (d, 1H), 8.42-8.43 (d, 1H), 9.96-10.00 (d, 1H)
11		1.29-1.33 (m, 3H), 2.21 (s, 3H), 4.14-4.28 (d, 4H), 5.83-5.96 (d, 2H), 6.59-6.66 (m, 2H), 7.26-7.36 (m, 3H), 7.83-7.85 (d, 1H), 8.43-8.44 (d, 1H), 9.84 (s, 1H)
12		1.64-1.91 (m, 4H), 2.05 (s, 3H), 3.21-3.24 (m, 2H), 3.53-3.57 (m, 2H), 5.77-5.90 (d, 2H), 6.98-7.02 (m, 3H), 7.27-7.35 (m, 2H), 7.80-7.82 (d, 1H), 8.43-8.44 (d, 1H), 10.10 (s, 1H)
13		2.04 (s, 3H), 2.76 (s, 3H), 3.07 (s, 3H), 5.81-5.94 (d, 2H), 6.95 (s, 2H), 7.05 (s, 1H), 7.32-7.36 (m, 1H), 7.81-7.83 (d, 1H), 8.44-8.45 (d, 1H), 9.86 (s, 1H)
14		0.95-0.98 (m, 3H), 1.17-1.20 (m, 3H), 2.08 (s, 3H), 3.05-3.46 (m, 4H), 5.82-5.96 (d, 2H), 6.90-7.37 (m, 4H), 7.82-7.84 (d, 1H), 8.44-8.45 (d, 1H), 9.74 (s, 1H)
15		2.01 (s, 3H), 3.19-4.01 (m, 8H), 5.74-5.93 (dd, 2H), 6.90-7.36 (m, 5H), 7.83-7.85 (d, 1H), 8.46 (s, 1H), 9.99 (s, 1H)
16		1.44 (s, 6H), 2.11 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 5.83-5.96 (d, 2H), 6.71 (s, 1H), 7.22-7.36 (m, 2H), 7.82-7.84 (d, 2H), 8.44-8.46 (d, 1H), 9.91 (s, 1H)
17	251-252	1.63 (s, 6H), 2.21 (s, 3H), 2.91 (s, 3H), 3.73 (s, 2H), 5.83-5.96 (d, 2H), 6.27 (s, 1H), 6.66 (s, 1H), 7.33-7.37 (m, 2H), 7.84-7.86 (d, 1H), 8.45-8.46 (d, 1H), 9.50 (s, 1H)
18	190	2.21 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 4.16-4.18 (d, 2H), 5.83-5.96 (d, 2H), 6.60-6.67 (m, 2H), 7.27-7.36 (m, 3H), 7.83-7.85 (d, 1H), 8.43-8.44 (d, 1H), 9.82 (s, 1H)

21		0.86(s, 9H), 0.75-2.04(m, 5H), 2.04(s, 3H), 2.61-2.83(m, 2H), 3.41-3.47(m, 1H), 4.72-4.80(m, 1H), 5.82-5.96(d, 2H), 6.92-7.34(m, 3H), 7.81-7.83(d, 1H), 8.43(s, 1H), 9.89(s, 1H)
22		1.25-1.63(m, 6H), 2.03(s, 3H), 3.02-3.12(m, 2H), 3.61-3.68(m, 2H), 5.81-5.95(d, 2H), 6.93-7.35(m, 4H), 7.81-7.83(d, 1H), 8.42-8.44(d, 1H), 9.87(s, 1H)
23		0.755-1.611(m, 11H), 2.03(s, 3H), 2.76-3.26(m, 2H), 4.72-4.83(m, 1H), 5.82-5.96(d, 2H), 6.85-7.36(m, 4H), 7.82-7.84(d, 1H), 8.43(s, 1H)
24		0.85-0.88(m, 3H), 1.32-1.50(m, 4H), 2.17(s, 3H), 3.74(s, 2H), 5.84-5.98(d, 2H), 6.94-7.57(m, 4H), 8.09-8.11(d, 1H), 8.44-8.45(d, 1H), 10.14(s, 1H), 11.30(s, 1H)
25		2.17(s, 3H), 3.57(s, 3H), 5.86-5.99(d, 2H), 6.96-7.56(m, 4H), 8.11-8.13(d, 1H), 8.46(s, 1H), 10.76(s, 1H), 11.43(s, 1H)
26	224-226	1.10-1.14(m, 3H), 2.18(s, 3H), 3.77-3.80(m, 2H), 5.85-5.98(d, 2H), 6.95-7.57(m, 4H), 8.10-8.12(d, 1H), 8.45-8.46(d, 1H), 10.14(s, 1H),
27		1.24-1.36(m, 5H), 2.11(s, 3H), 3.60-3.61(m, 2H), 5.85-5.99(d, 2H), 6.59-6.92(m, 4H), 8.10-8.13(d, 1H), 8.47-8.48(d, 1H), 10.23(s, 1H)
33 (实施例 3)	151-152	1.23-1.27(m, 3H), 2.26(s, 3H), 3.45-3.48(m, 2H), 5.84-5.98(d, 2H), 6.23(s, 1H), 6.64(s, 1H), 7.36-8.48(m, 5H), 10.52(s, 1H)
34	226-227	0.97-1.00(m, 3H), 1.59-1.65(m, 2H), 2.25(s, 3H), 3.35-3.40(m, 2H), 5.83-5.97(d, 2H), 6.22(s, 1H), 6.62(s, 1H), 7.35-7.38(m, 1H), 7.58(s, 1H), 7.83-7.85(d, 1H), 8.46-8.47(d, 1H), 10.47(brs, 1H)
35	220-221	0.95-0.98(m, 3H), 0.95-1.61(m, 4H), 2.26(s, 3H), 3.40-3.45(m, 2H), 5.84-5.97(d, 2H), 6.13(s, 1H), 6.61(s, 1H), 7.35-7.86(m, 4H), 8.46-8.47(d, 1H), 10.48(s, 1H)
36	218-219	2.21(s, 3H), 3.27(s, 3H), 5.86-5.99(d, 2H), 6.96(s, 1H), 7.55-8.47(m, 6H), 10.45(s, 1H)
37	227-228	2.25(s, 3H), 2.94-3.62(m, 8H), 5.86-5.99(d, 2H), 6.70(s, 1H), 7.58-8.48(m, 5H), 10.37(s, 1H)
38	286-287	0.93-0.99(m, 3H), 1.46-1.61(m, 3H), 2.17(s, 3H), 2.96-3.12(m, 2H), 3.41-3.52(m, 2H), 5.82-5.96(d, 2H),

		6.73-6.74(d, 1H), 7.27-7.86(m, 5H), 8.44-8.45(d, 1H), 7.77-7.79(d, 1H)
39	214-215	DMSO-d ₆ : 0.81-0.85(m, 3H), 1.40-1.45(m, 2H), 2.16(s, 3H), 3.06-3.09(m, 2H), 5.85-5.98(d, 2H), 6.93(s, 1H), 7.44-7.59(m, 3H), 8.10-8.46(m, 3H), 10.14(s, 1H)
40		0.95-2.22(m, 10H), 2.11(s, 3H), 3.32-3.75(m, 2H), 4.62-5.02(m, 2H), 5.82-5.95(d, 2H), 6.91-7.35(m, 4H), 7.80-7.82(d, 1H), 8.42(s, 1H), 9.88(s, 1H)
41	135-136	0.64-2.43(m, 14H), 2.05(s, 3H), 3.39-3.75(m, 2H), 4.69-5.03(m, 2H), 5.81-5.94(d, 2H), 6.88-7.35(m, 4H), 7.80-7.82(d, 1H), 8.42(s, 1H), 9.69(s, 1H)
42		2.23(s, 3H), 2.62(s, 3H), 2.89(s, 3H), 5.85-5.99(d, 2H), 6.92(s, 1H), 7.58-8.49(m, 5H), 10.46(s, 1H)
		DMSO-d ₆ : .89-0.95(m, 3H), 1.11-1.97(m, 9H), 2.20(s, 3H), 3.60-3.62(m, 1H), 5.83-5.97(d, 2H), 6.67-6.68(d, 1H), 7.21-7.37(m, 3H), 7.82-7.84(d, 1H), 8.45-8.46(d, 1H), 10.05(s, 1H)
43	252-253	DMSO-d ₆ : .71-0.79(m, 3H), 0.99-1.79(m, 9H), 2.22(s, 3H), 3.26-3.33(m, 1H), 5.85-5.98(d, 2H), 6.95-6.97(d, 1H), 7.54-8.45(m, 5H), 10.05(s, 1H)
44		DMSO-d ₆ : 1.08-1.74(m, 10H), 2.22(s, 3H), 3.59-3.61(m, 1H), 5.86-5.99(d, 2H), 6.99(s, 1H), 7.56-8.46(m, 5H), 10.38(s, 1H)
45		DMSO-d ₆ :0.83-0.86(m, 3H), 1.25-1.45(m, 6H), 2.21(s, 3H), 3.11-3.16(m, 2H), 5.86-5.99(d, 2H), 6.95(s, 1H), 7.55-8.47(m, 6H), 10.42(s, 1H)
46	233-237	DMSO-d ₆ : 1.27(s, 9H), 2.21(s, 3H), 5.85-5.98(d, 2H), 6.96(s, 1H), 7.55-8.47(m, 6H), 10.33(s, 1H)
47	142-143	DMSO-d ₆ : 2.22(s, 3H), 4.34-4.36(d, 2H), 5.86-5.99(d, 2H), 6.26-6.37(d, 2H), 6.92(s, 1H), 7.53-8.85(m, 7H), 10.41(s, 1H)
48		DMSO-d ₆ :1.41-1.50(m, 4H), 2.30(s, 3H), 2.91-3.47(m, 6H), 5.85-5.98(d, 2H), 6.97(s, 1H), 7.57-7.82(m, 3H), 8.13-8.15(d, 1H), 8.46-8.47(d, 1H)
49	181-182	0.91-0.96(m, 3H), 1.37-1.64(m, 2H), 2.03(s, 3H), 2.92-3.39(m, 4H), 5.81-5.94(d, 2H), 6.93-7.35(m, 4H), 7.80-7.82(d, 1H), 8.42-8.43(d, 1H)
50	234.5-240	1.14-1.96(m, 10H), 2.36(s, 3H), 3.82-3.87(m, 1H), 5.83-5.96(d, 2H), 6.67(s, 1H), 7.33-7.40(m, 3H), 7.81-7.83(d, 1H), 8.44-8.46(d, 1H), 10.04(s, 1H)
51	223-224	2.17(s, 3H), 2.93-2.94(d, 3H), 5.83-5.96(d, 2H), 6.16(s, 1H),

		6. 70(s, 1H), 7. 34-7. 39(m, 3H), 7. 82-7. 84(d, 1H), 8. 44-8. 45 (d, 1H), 9. 98(s, 1H)
52	217-220. 5	DMSO-d ₆ : 0. 87-1. 04(m, 6H), 2. 20(s, 3H), 2. 91-3. 27 (m, 4H), 5. 83-5. 97(d, 2H), 6. 93(s, 1H), 7. 56-7. 83(m, 3H), 8. 12-8. 14(d, 1H), 8. 46-8. 47(d, 1H), 10. 43(s, 1H)
53	134-137	DMSO-d ₆ : 2. 19(s, 3H), 3. 62(s, 3H), 5. 86-5. 99(d, 2H), 6. 97(s, 1H), 7. 54-7. 90(m, 3H), 8. 10-8. 12(d, 1H), 8. 45-8. 46(d, 1H)
54	270. 5-27 2	DMSO-d ₆ : 1. 46-1. 77(m, 4H), 2. 26(s, 3H), 3. 07-3. 30(m, 4H), 5. 85-5. 98(d, 2H), 6. 97(s, 1H), 7. 57-7. 83(m, 3H), 8. 13-8. 15(d, 1H), 7. 57-7. 83(m, 3H), 8. 13-8. 16(dd, 1H), 8. 46-8. 48(d, 1H)
55	231	DMSO-d ₆ : 0. 82-0. 86(m, 3H), 1. 22-1. 44(m, 4H), 2. 15 (s, 3H), 3. 10.-3. 15(m, 2H), 5. 85-5. 98(d, 2H), 6. 92(s, 1H), 7. 43-7. 58(m, 3H), 8. 09-8. 10(d, 1H), 8. 18(s, 1H), 8. 45-8. 46(d, 1H), 10. 14(s, 1H)
56	243-246. 5	DMSO-d ₆ : 2. 62(s, 3H), 2. 88(s, 3H), 5. 84-5. 98(d, 2H), 6. 90(s, 1H), 7. 33-7. 59(m, 3H), 8. 13-8. 15(d, 1H), 8. 47-8. 48(d, 1H), 10. 21(brs, 1H)
57	226-234	1. 35(s, 9H), 2. 13(s, 3H), 5. 82-5. 95(d, 2H), 6. 01(brs, 1H), 6. 97-7. 35(m, 3H), 7. 80-7. 82(d, 2H), 8. 42-8. 44(d, 1H), 10. 18(s, 1H)
58	215-216. 5	1. 19-1. 20(d, 6H), 2. 17(s, 3H), 4. 14-4. 19(m, 1H), 5. 82-5. 95 (d, 2H), 5. 95(s, 1H), 6. 74(s, 1H), 7. 26-7. 37(m, 3H), 7. 81-7. 83(d, 1H), 8. 44-8. 45(d, 1H), 10. 07(s, 1H)
59	225. 0-22 7. 5	1. 19-1. 23(m, 3H), 2. 19(s, 3H), 3. 38-3. 45(m, 2H), 5. 82-5. 96(d, 2H), 6. 08(brs, 1H), 7. 33-7. 41(m, 3H), 7. 81-7. 84(d, 1H), 8. 44-8. 46(d, 1H), 10. 00(s, 1H)
60	222-224	0. 88-0. 91(m, 3H), 1. 31-1. 56(m, 6H), 2. 16(s, 3H), 3. 32-3. 37(m, 2H), 5. 82-5. 96(d, 2H), 6. 18(s, 1H), 6. 77(s, 1H), 7. 26-7. 36(m, 3H), 7. 81-7. 83(d, 2H), 8. 43-8. 45(d, 1H), 10. 07(s, 1H)
61	225-226	0. 86-0. 93(m, 3H), 1. 49-1. 78(m, 9H), 1. 90-1. 94(d, 1H), 2. 18(s, 3H), 3. 58-3. 60(d, 1H), 5. 82-5. 95(d, 2H), 6. 72-6. 73(d, 1H), 7. 27-7. 40(m, 3H), 7. 81-7. 83(m, 1H), 8. 44-8. 45(m, 1H), 10. 04-10. 05(d, 1H)
62	162-165	0. 93-1. 19(m, 6H), 2. 05(s, 3H), 3. 03-3. 48(m, 4H), 5. 80-5. 94 (d, 2H), 6. 94(s, 1H), 7. 10(s, 1H), 7. 24-7. 36(m, 2H), 7. 80-7. 82(d, 1H), 8. 42-8. 43(d, 1H), 9. 90(s, 1H)
63	204-206	1. 61-1. 65(m, 4H), 2. 03(s, 3H), 3. 20-3. 23(m, 2H), 3. 53-3. 56

		(m, 2H), 5.76-5.89(d, 2H), 7.04(s, 1H), 7.12-7.28(m, 3H), 7.31-7.34(m, 1H), 7.79-7.81(m, 1H), 8.42-8.44(m, 1H), 10.24(s, 1H)
64	188	2.19(s, 3H), 4.55-4.56(d, 2H), 5.84-5.97(m, 2H), 6.28-6.33(m, 2H), 6.45(brs, 1H), 6.64(s, 1H), 7.27-7.42(m, 4H), 7.81-7.84(d, 1H), 8.44-8.45(d, 1H), 9.90(s, 1H)
65	217-218	2.18(s, 3H), 3.80(s, 3H), 5.82-5.95(d, 2H), 6.67(s, 1H), 7.33-7.36(m, 2H), 7.44(s, 1H), 7.83-7.85(s, 1H), 8.43-8.44(d, 1H), 8.89(s, 1H), 9.50(s, 1H)
66	229-231	DMSO-d ₆ : 1.10-1.14(m, 3H), 2.18(s, 3H), 3.75-3.80(m, 2H), 5.85-5.98(d, 2H), 6.95(s, 1H), 7.40(s, 1H), 7.54-7.57(m, 1H), 7.63(s, 1H), 8.10-8.12(m, 1H), 8.45-8.46(s, 1H), 10.14(s, 1H), 11.31(s, 1H)
67	209-216	0.92-0.95(m, 3H), 1.40-1.65(m, 4H), 2.27(s, 3H), 3.94(s, 2H), 5.82-5.95(d, 2H), 6.65-6.69(d, 1H), 7.32-7.36(m, 2H), 7.42-7.44(d, 1H), 7.82-7.84(d, 2H), 8.43-8.44(d, 1H), 8.72(s, 1H), 9.57(s, 1H)
68	223-225.5	2.21(s, 3H), 3.80(s, 3H), 4.16-4.18(d, 2H), 5.83-5.96(d, 2H), 6.58-6.63(d, 2H), 7.33-7.36(m, 1H), 7.48-7.51(d, 2H), 7.83-7.85(d, 1H), 8.43-8.44(d, 1H), 9.80(s, 1H)
69		1.22-1.32(m, 3H), 2.19(s, 3H), 4.13-4.14(d, 2H), 4.22-4.27(m, 2H), 5.82-5.95(d, 2H), 6.61-6.69(m, 2H), 7.32-7.35(m, 1H), 7.44-7.48(d, 2H), 7.82-7.84(m, 1H), 8.42-8.43(d, 1H), 9.84(s, 1H)
70	217-222	2.03(s, 3H), 3.20-4.01(m, 8H), 5.76-5.90(d, 2H), 6.97-7.04(m, 2H), 7.19-7.21(d, 1H), 7.34-7.37(m, 1H), 7.83-7.85(d, 1H), 8.45-8.46(m, 1H), 9.88(s, 1H)
71	230-235	1.31(s, 2H), 1.58-1.63(m, 4H), 2.04(s, 3H), 3.09-3.66(m, 4H), 5.81-5.94(d, 2H), 6.95(s, 1H), 7.06-7.07(d, 1H), 7.21-7.22(d, 1H), 7.31-7.35(m, 1H), 7.80-7.82(m, 1H), 8.41-8.43(m, 1H), 9.86(s, 1H)
72	185-186	0.84-1.09(m, 3H), 1.22-1.62(m, 8H), 2.04(s, 3H), 2.75-3.25(m, 2H), 4.71-4.80(d, 1H), 5.81-5.94(d, 2H), 6.98(s, 1H), 7.10(s, 1H), 7.21(s, 1H), 7.31-7.34(m, 1H), 7.80-7.82(m, 1H), 8.42(s, 1H), 9.71-9.95(s, 1H)
73	221-222	0.86(s, 9H), 1.15-1.82(m, 5H), 2.05(s, 3H), 2.60-4.84(m, 4H), 5.81-5.95(d, 2H), 6.91(brs, 1H), 7.08(s, 1H), 7.23-7.34(m, 2H), 7.81-7.83(d, 1H), 8.42(s, 1H),

		9.88 (brs, 1H)
74	180-181	2.12 (s, 3H), 3.28 (s, 3H), 4.38 (s, 2H), 5.77-5.90 (d, 2H), 6.32 (s, 1H), 7.17-7.27 (m, 2H), 7.38-7.40 (d, 1H), 7.85-.87 (d, 1H), 8.43-8.44 (d, 1H), 9.05 (s, 1H)
75		2.21 (s, 3H), 2.92-2.93 (d, 3H), 5.83-5.96 (d, 2H), 6.18-6.20 (d, 1H), 6.64 (s, 1H), 7.12-7.15 (m, 1H), 7.21-7.23 (m, 1H), 7.32-7.35 (m, 2H), 7.82-7.84 (d, 1H), 8.44-8.46 (d, 1H), 10.11 (s, 1H)
76		1.19-1.23 (t, 3H), 2.22 (s, 3H), 3.39-3.46 (m, 2H), 5.83-5.96 (d, 2H), 6.01 (s, 1H), 6.63 (s, 1H), 7.13-7.17 (m, 1H), 7.24-7.28 (m, 1H), 7.32-7.35 (m, 2H), 7.82-7.83 (d, 1H), 8.45-8.46 (d, 1H), 10.11 (s, 1H)
77		1.38 (s, 9H), 2.17 (s, 3H), 5.83-5.96 (d, 2H), 5.96 (s, 1H), 6.78 (s, 1H), 7.08-7.12 (m, 1H), 7.17-7.18 (m, 2H), 7.31-7.35 (m, 1H), 7.80-7.82 (d, 1H), 8.44-8.46 (d, 1H), 10.13 (s, 1H)
78		2.06 (s, 3H), 3.23 (m, 2H), 3.36 (m, 2H), 3.52 (m, 3H), 3.68-3.70 (m, 1H), 5.78-5.91 (d, 2H), 6.86 (s, 1H), 6.94-6.96 (m, 1H), 7.03-7.09 (m, 2H), 7.33-7.36 (m, 1H), 7.82-7.84 (d, 1H), 8.44-8.46 (d, 1H), 9.64 (s, 1H)
79		DMSO-d ₆ : 0.45 (m, 2H), 0.62-0.63 (m, 2H), 2.16 (s, 3H), 2.71-2.72 (m, 1H), 5.86-5.99 (d, 2H), 6.95 (s, 1H), 7.21-7.27 (m, 2H), 7.32-7.34 (d, 1H), 7.54-7.57 (m, 1H), 8.10-8.12 (d, 2H), 8.46-8.47 (d, 1H), 10.13 (s, 1H)
80		DMSO-d ₆ : 0.46 (m, 2H), 0.60-0.64 (m, 2H), 2.16 (s, 3H), 2.67-2.71 (m, 1H), 5.86-5.99 (d, 2H), 6.95 (s, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.55-7.58 (m, 2H), 8.10-8.13 (d, 1H), 8.25-8.26 (d, 1H), 8.46-8.47 (d, 1H), 10.13 (s, 1H)
81		DMSO-d ₆ : 0.64-0.69 (m, 2H), 0.74-0.75 (m, 2H), 2.92-2.93 (m, 1H), 5.88-6.02 (d, 2H), 6.74 (s, 1H), 7.16-7.20 (m, 1H), 7.45-7.49 (m, 1H), 7.61-7.64 (m, 1H), 7.77-7.79 (m, 1H), 8.19-8.21 (m, 2H), 8.51-8.52 (d, 1H), 8.78 (s, 1H), 12.53 (s, 1H),
82	231-233	DMSO-d ₆ : 0.47 (m, 2H), 0.60-0.65 (m, 2H), 1.16-1.20 (t, 1H), 2.19 (s, 3H), 4.01-4.06 (m, 1H), 5.87-6.00 (d, 2H), 6.98 (s, 1H), 7.28-7.30 (d, 1H), 7.42-7.44 (d, 1H), 7.55-7.58 (m, 1H), 8.10-8.12 (d, 1H), 8.29-8.30 (d, 1H), 8.46-8.48 (d, 1H)
83	252-253	DMSO-d ₆ : 0.46-0.50 (m, 2H), 0.59-0.64 (m, 2H), 1.16-1.20 (t, 1H), 2.12 (s, 3H), 4.01-4.06 (m, 1H), 5.86-5.99 (d, 2H), 6.95 (s, 1H), 7.54-7.58 (m, 3H), 7.73 (s, 1H), 8.10-8.12 (d, 1H)

84	163-164	DMSO-d ₆ : 1.15-1.25 (t, 3H), 2.22 (s, 3H), 3.92-3.94 (d, 2H), 4.08-4.13 (m, 2H), 5.85-5.98 (d, 2H), 6.04 (s, 1H), 6.93 (s, 1H), 7.51-7.58 (m, 2H), 7.78 (s, 1H), 8.10-8.13 (m, 1H), 8.46-8.47 (d, 1H), 10.41 (s, 1H)
85	219-220	1.36 (s, 9H), 2.13 (s, 3H), 5.82-5.95 (d, 2H), 5.98 (s, 1H), 6.92 (s, 1H), 7.32-7.35 (m, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.81-7.83 (d, 1H), 8.43-8.44 (d, 1H), 10.15 (s, 1H)
86	150-152	DMSO-d ₆ : 1.36 (s, 9H), 2.35 (s, 3H), 5.84-6.00 (d, 2H), 7.03 (s, 1H), 7.54-7.60 (m, 1H), 8.08-8.18 (m, 2H), 8.32-8.38 (m, 2H), 8.47-8.48 (m, 1H)
87	201-202	1.50 (s, 9H), 5.85-5.98 (d, 2H), 6.09 (s, 1H), 6.63 (s, 1H), 7.05-7.09 (m, 1H), 7.36-7.43 (m, 3H), 7.88-7.90 (d, 1H), 8.49-8.51 (d, 2H), 12.21 (s, 1H)
88	226-227	1.36 (s, 9H), 2.15 (s, 3H), 5.82-5.96 (d, 2H), 5.96 (s, 1H), 6.92 (s, 1H), 7.05-7.07 (d, 1H), 7.18-7.20 (d, 1H), 7.32-7.35 (m, 1H), 7.81-7.83 (d, 1H), 8.43-8.45 (d, 1H), 10.40 (s, 1H)
89	230-231	1.33 (s, 9H), 5.81-5.94 (d, 2H), 6.07 (s, 1H), 6.98 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.30-7.36 (m, 2H), 7.82-7.84 (d, 1H), 8.43-8.44 (d, 1H), 9.90 (s, 1H)
90	201-202	1.20-1.32 (m, 2H), 1.44-1.53 (m, 2H), 1.67-1.72 (m, 2H), 1.79-1.82 (m, 2H), 2.05-2.07 (m, 2H), 3.99-4.01 (m, 1H), 5.85-5.98 (d, 2H), 6.12-6.14 (d, 1H), 6.66 (s, 1H), 7.08-7.11 (m, 1H), 7.39-7.48 (m, 3H), 7.88-7.90 (d, 1H), 8.47-8.51 (m, 2H), 12.31 (s, 1H)
91	239-240	DMSO-d ₆ : 1.07-1.27 (m, 5H), 1.55-1.58 (m, 1H), 1.66-1.73 (m, 4H), 2.13 (s, 3H), 3.58-3.60 (m, 1H), 5.85-5.98 (d, 2H), 6.95 (s, 1H), 7.54-7.57 (m, 2H), 7.73 (s, 1H), 8.01 (s, 1H), 8.11-8.12 (d, 1H), 8.44-8.46 (d, 1H), 10.10 (s, 1H)
92	225-226	DMSO-d ₆ : 1.07-1.31 (m, 5H), 1.55-1.58 (m, 1H), 1.66-1.74 (m, 4H), 2.20 (s, 3H), 3.60 (m, 1H), 5.86-5.99 (d, 2H), 6.96 (s, 1H), 7.30-7.32 (d, 1H), 7.43-7.45 (d, 1H), 7.55-7.58 (m, 1H), 7.97 (s, 1H), 8.10-8.12 (d, 1H), 8.45-8.46 (d, 1H), 10.03 (s, 1H)
93	246-247	1.08-1.18 (m, 3H), 1.34-1.40 (m, 2H), 1.66-1.74 (m, 3H), 1.87-1.90 (m, 2H), 3.82-3.84 (t, 1H), 5.82-5.95 (d, 2H), 6.06-6.08 (d, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.25 (s, 1H), 7.34-7.37 (m, 2H), 7.82-7.84 (m, 1H), 8.44-8.46 (m, 1H), 9.74 (s, 1H)

94	227-228	DMSO-d ₆ : 2.84-2.85(d, 3H), 5.88-6.01(d, 2H), 6.72(s, 1H), 7.18-7.22(m, 1H), 7.46-7.50(m, 1H), 7.61-7.65(m, 1H), 7.81-7.83(d, 1H), 8.19-8.27(m, 2H), 8.51-8.52(d, 1H), 8.84(s, 1H), 12.71(s, 1H)
95	213-216	DMSO-d ₆ : 2.13(s, 3H), 2.66-2.67(d, 3H), 5.85-5.99(d, 2H), 6.93(s, 1H), 7.54-7.58(m, 1H), 7.61(s, 1H), 7.74(s, 1H), 8.10-8.13(d, 1H), 8.18(s, 1H), 8.47-8.48(d, 1H), 10.06(s, 1H)
96	221-222	DMSO-d ₆ : 2.19(s, 3H), 2.68-2.69(d, 3H), 5.86-5.99(d, 2H), 6.95(s, 1H), 7.32-7.35(m, 1H), 7.44-7.47(m, 1H), 7.55-7.58(m, 1H), 8.11-8.13(d, 2H), 8.46-8.49(d, 1H), 10.10(s, 1H)
97	134-135	DMSO-d ₆ : 2.66-2.67(d, 3H), 5.85-5.98(d, 2H), 6.98(s, 1H), 7.50(s, 1H), 7.55-7.57(m, 1H), 7.79(s, 1H), 8.10-8.12(d, 1H), 8.28(s, 1H), 8.46-8.47(d, 1H), 10.36(s, 1H)
98	165-166	DMSO-d ₆ : 2.67(s, 3H), 2.80(s, 3H), 5.85-6.01(d, 2H), 6.90(s, 1H), 7.25-7.32(m, 2H), 7.38(s, 2H), 7.57-7.64(m, 1H), 8.14-8.16(d, 1H), 8.48-8.49(d, 1H), 10.20(s, 1H)
99	236-237	DMSO-d ₆ : 2.61(s, 3H), 2.88(s, 3H), 5.84-5.98(d, 2H), 6.90(s, 1H), 7.46(s, 1H), 7.56-7.62(m, 1H), 7.71(s, 1H), 8.10-8.21(d, 1H), 8.47-8.48(d, 1H), 9.58(s, 1H)
100	222-223	2.67(s, 3H), 2.89(s, 3H), 5.85-5.98(d, 2H), 6.97(s, 1H), 7.45(s, 1H), 7.57-7.60(m, 1H), 7.79(s, 1H), 8.13-8.15(d, 1H), 8.48-8.49(d, 1H), 10.20(s, 1H)
101	199-200	DMSO-d ₆ : 0.44(m, 2H), 0.55(m, 2H), 0.61-0.62(t, 1H), 4.01(m, 1H), 5.85-5.99(d, 2H), 7.00(s, 1H), 7.45(s, 1H), 7.55-7.58(m, 1H), 7.78(s, 1H), 8.10-8.12(d, 1H), 8.46-8.48(d, 2H)
103	186-187	1.12-1.16(t, 3H), 3.34-3.41(m, 2H), 5.82-5.95(d, 2H), 6.25(s, 1H), 6.80(s, 1H), 7.35-7.37(m, 2H), 7.82-7.84(d, 1H), 8.44-8.45(m, 1H), 9.65(s, 1H)
104	197-200	DMSO-d ₆ : 1.02-1.04(d, 6H), 3.87-3.92(m, 1H), 5.85-5.98(d, 2H), 7.02(s, 1H), 7.44(s, 1H), 7.54-7.58(m, 1H), 7.80(s, 1H), 8.10-8.11(d, 2H), 8.45-8.46(d, 1H), 10.33(s, 1H)
105	170-171	0.90-0.93(t, 3H), 1.47-1.52(m, 2H), 3.26-3.31(m, 2H), 5.81-5.94(d, 2H), 6.29(s, 1H), 6.83(s, 1H), 7.32-7.35(m, 2H), 7.81-7.83(d, 1H), 8.43-8.44(d, 1H), 9.69(s, 1H)
106	177-178	0.66-0.70(m, 1H), 0.92-0.96(m, 3H), 1.14-1.18(m, 1H), 1.44-1.61(m, 3H), 2.93-3.05(m, 2H), 3.38(m, 2H), 5.80-5.93(d, 2H), 6.98-7.05(m, 2H), 7.31-7.34(m, 1H), 7.80-7.82(d, 1H), 8.42-8.43(d, 1H), 9.99(s, 1H)
107	232-234	4.52-4.57(d, 2H), 5.81-5.83(d, 2H), 6.26-6.31(d, 2H), 6.48(s, 1H), 6.64(s, 1H), 7.34(s, 3H), 7.47(s, 1H),

		7. 82-7. 84 (d, 1H), 8. 44-8. 45 (d, 1H), 9. 35 (s, 1H)
108	186-187	1. 28-1. 32 (t, 3H), 4. 09-4. 10 (d, 2H), 4. 21-4. 26 (m, 2H), 5. 81-5. 96 (d, 2H), 6. 69 (s, 1H), 6. 87 (s, 1H), 7. 26 (s, 1H), 7. 41-7. 47 (m, 2H), 7. 82-7. 84 (m, 1H), 8. 41-8. 42 (d, 1H), 9. 41 (s, 1H)
109	122-123	1. 38 (s, 6H), 2. 10 (s, 3H), 2. 93 (s, 2H), 5. 80-5. 94 (d, 2H), 6. 20 (s, 1H), 6. 84 (s, 1H), 7. 26-7. 34 (m, 3H), 7. 82-7. 84 (d, 1H), 8. 43-8. 44 (d, 1H), 9. 68 (s, 1H)
110	148-149	DMSO-d ₆ : 0. 45-0. 48 (m, 1H), 0. 58-0. 65 (m, 3H), 2. 21 (s, 3H), 2. 70-2. 71 (m, 1H), 5. 86-5. 99 (d, 2H), 6. 97 (s, 1H), 7. 55-7. 58 (m, 1H), 7. 72 (s, 1H), 7. 84 (s, 1H), 8. 10-8. 13 (d, 1H), 8. 46-8. 47 (m, 2H)
111	190-192	DMSO-d ₆ : 1. 17 (d, 3H), 2. 15 (s, 3H), 3. 24-3. 27 (d, 3H), 3. 88-3. 94 (m, 1H), 5. 85-5. 98 (d, 2H), 6. 95 (s, 1H), 7. 54-7. 57 (m, 2H), 7. 73 (s, 1H), 7. 99-8. 01 (d, 1H), 8. 09-8. 11 (d, 1H), 8. 44-8. 46 (d, 1H), 10. 11 (s, 1H)
112	153-155	1. 17-1. 21 (t, 3H), 2. 15 (s, 3H), 3. 38-3. 43 (m, 2H), 5. 82-5. 96 (d, 2H), 6. 20 (s, 1H), 6. 70 (s, 1H), 7. 26-7. 36 (m, 1H), 7. 58-7. 59 (d, 2H), 7. 81-7. 83 (d, 1H), 8. 44-8. 46 (d, 1H)
113	230-231	0. 93-0. 97 (t, 3H), 1. 54-1. 59 (m, 2H), 2. 15 (s, 3H), 3. 30-3. 35 (m, 2H), 5. 82-5. 96 (d, 2H), 6. 15 (s, 1H), 6. 72 (s, 1H), 7. 26-7. 36 (m, 1H), 7. 51-7. 59 (d, 2H), 7. 81-7. 83 (d, 1H), 8. 44-8. 46 (d, 1H), 10. 07 (s, 1H)
114	230-231	DMSO-d ₆ : 2. 18 (s, 3H), 2. 50 (s, 3H), 2. 87-2. 90 (s, 3H), 5. 85-5. 98 (d, 2H), 6. 91 (s, 1H), 7. 15-7. 17 (d, 1H), 7. 45- 7. 47 (d, 1H), 7. 56-7. 59 (m, 1H), 8. 13-8. 15 (d, 1H), 8. 48-8. 49 (d, 1H), 10. 05 (s, 1H)
116		DMSO-d ₆ : 2. 09 (s, 3H), 3. 85 (brs, 1H), 3. 97-4. 01 (m, 2H), 4. 59-4. 61 (m, 2H), 5. 88-6. 01 (d, 2H), 6. 48 (s, 1H), 7. 23-7. 25 (m, 1H), 7. 57 (s, 1H), 7. 90-7. 92 (d, 1H), 8. 12-8. 13 (m, 1H), 8. 22 (s, 1H)
117		4. 36-4. 37 (d, 2H), 5. 85-5. 98 (d, 2H), 6. 62 (s, 1H), 6. 99 (brs, 1H), 7. 09 (m, 4H), 7. 91-7. 93 (d, 1H), 8. 47-8. 53 (m, 2H)
118	201-203	2. 95-2. 96 (d, 3H), 5. 82-5. 95 (d, 2H), 6. 34 (brs, 1H), 7. 19-7. 37 (m, 3H), 7. 86 (s, 1H), 8. 44-8. 45 (d, 1H)
119	142-146	1. 17-1. 20 (t, 3H), 3. 36-3. 43 (m, 2H), 5. 81-5. 94 (d, 2H), 6. 36 (brs, 1H), 6. 66 (s, 1H), 7. 15-7. 36 (m, 3H), 7. 83-7. 84 (d, 1H), 8. 43-8. 44 (d, 1H)
120	132-135	0. 95-0. 99 (t, 3H), 1. 56-1. 60 (m, 2H), 3. 33 (m, 2H), 5. 83-5. 96 (d, 2H), 6. 25 (brs, 1H), 6. 63 (s, 1H), 7. 13-7. 46 (m, 3H), 7. 84-7. 86 (d, 1H), 8. 45-8. 46 (d, 1H)
121	162-165	1. 22-1. 24 (d, 6H), 4. 16-4. 21 (m, 1H), 5. 82-5. 95 (d, 2H), 6. 00-6. 02 (d, 1H), 6. 64 (s, 1H), 7. 13-7. 47 (m, 2H), 7. 84-7. 86 (d, 1H), 8. 45-8. 46 (d, 1H),

122	186-189	0.94-0.96 (t, 3H), 1.35-1.80 (m, 4H), 3.37-3.42 (m, 2H), 5.83-5.96 (d, 2H), 6.22 (brs, 1H), 6.63 (s, 1H), 7.21-7.38 (m, 3H), 7.85-7.86 (d, 1H), 8.46-8.47 (d, 1H)
123	239-242	1.42 (s, 9H), 5.83-5.96 (d, 2H), 5.91 (s, 1H), 6.67 (s, 1H), 7.16-7.38 (m, 3H), 7.84-7.86 (d, 1H), 8.47-8.48 (d, 1H)
124	150-154	0.58-0.62 (m, 2H), 0.86-0.91 (m, 2H), 5.82-5.96 (d, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.64 (s, 1H), 7.19-7.47 (m, 3H), 7.84-7.86 (d, 1H), 8.46-8.47 (d, 1H), 9.96 (s, 1H)
125	218-220	2.83 (s, 3H), 3.07 (s, 3H), 5.83-5.96 (d, 2H), 6.90-7.38 (m, 4H), 7.84-7.86 (d, 1H), 8.46-8.47 (d, 1H), 9.90 (s, 1H)
127	170-173	0.90-0.96 (dd, 3H), 1.11-1.79 (m, 9H), 5.82-5.96 (d, 2H), 6.60 (s, 1H), 7.21-7.37 (m, 3H), 7.83-7.85 (d, 1H), 8.46-8.47 (d, 1H)
128	223-227	1.15-1.97 (m, 10H), 3.86-3.88 (m, 1H), 5.82-5.95 (d, 2H), 6.03-6.05 (d, 1H), 6.64 (s, 1H), 7.18-7.37 (m, 3H), 7.83-7.85 (d, 1H), 8.45-8.46 (d, 1H), 10.00 (s, 1H)
129	152-155	4.21-4.22 (d, 2H), 5.81-5.94 (d, 2H), 6.62 (s, 1H), 7.27-7.38 (m, 3H), 7.86-7.88 (d, 1H), 8.43-8.44 (d, 1H),
130	128-131	2.286 (s, 3H), 5.83-5.96 (d, 2H), 6.44 (s, 1H), 6.88 (s, 1H), 7.28-7.88 (m, 4H), 8.45-8.46 (d, 1H)
131	175-178	1.04-1.07 (t, 3H), 3.29-3.36 (m, 2H), 5.82-5.95 (d, 2H), 6.40 (s, 1H), 6.96-7.85 (m, 5H), 8.42-8.43 (d, 1H), 9.73 (s, 1H)
132	179-181	0.84-0.85 (m, 3H), 3.23-3.28 (m, 2H), 5.79-5.93 (d, 2H), 6.45 (brs, 1H), 7.27-7.85 (m, 4H), 8.42-8.43 (d, 1H), 9.74 (s, 1H)
133	215-219	1.06-1.07 (d, 6H), 4.05-4.10 (m, 1H), 5.82-5.95 (d, 2H), 6.25-6.27 (d, 1H), 6.98 (s, 1H), 7.34-7.85 (m, 5H), 8.42-8.43 (d, 1H)
134	207-210	0.85-0.88 (m, 3H), 1.19-1.43 (m, 4H), 3.26-3.31 (m, 2H), 5.82-5.92 (d, 2H), 6.40 (brs, 1H), 6.94 (s, 1H), 7.33-7.86 (m, 4H), 8.41-8.43 (d, 1H)
135	124-126	1.26 (s, 9H), 5.78-5.92 (d, 2H), 6.25-6.27 (d, 1H), 7.13-7.60 (m, 4H), 7.81-7.82 (d, 1H), 8.40-8.41 (d, 1H),
136		0.94-0.97 (t, 3H), 1.54-1.56 (m, 2H), 2.21 (s, 3H), 3.32-3.37 (m, 2H), 5.83-5.96 (d, 2H), 6.14-6.15 (m, 1H), 6.64 (s, 1H), 7.12-7.16 (m, 1H), 7.23-7.29 (m, 1H), 7.32-7.35 (m, 2H), 7.81-7.83 (d, 1H), 8.44-8.46 (d, 1H),
137		2.12 (s, 3H), 2.81 (s, 3H), 3.07 (s, 3H), 5.82-5.95 (d, 2H), 6.74 (s, 1H), 7.02-7.04 (m, 1H), 7.12-7.13 (m, 2H), 7.32-7.35 (m, 1H), 7.81-7.83 (d, 1H), 8.44-8.46 (d, 1H), 9.34 (s, 1H)
142	216-218	3.30-3.71 (m, 8H), 5.71-5.84 (d, 2H), 6.89-6.94 (m, 3H), 7.37-7.40 (m, 1H), 7.85-7.87 (d, 1H), 8.46-8.47 (d, 1H)
143	208-210	1.37-1.60 (m, 6H), 3.19-3.65 (m, 4H), 5.78-5.91 (d, 2H), 6.85-7.37 (m, 4H), 7.83-7.85 (d, 1H), 8.44-8.45 (d, 1H)

145	158-161	1. 31-1. 32 (m, 3H), 4. 14-4. 16 (d, 2H), 4. 17-4. 28 (m, 4H), 5. 83-5. 96 (d, 2H), 6. 59 (s, 1H), 6. 74 (brs, 1H), 7. 13-7. 34 (m, 3H), 7. 85-7. 87 (d, 1H), 8. 44-8. 45 (d, 1H)
146	193-195	4. 56-4. 57 (d, 2H), 5. 83-5. 96 (d, 2H), 6. 30-6. 59 (m, 4H), 7. 21-7. 38 (m, 3H), 7. 83-7. 85 (d, 1H), 8. 44-8. 45 (d, 1H), 9. 36 (s, 1H)
147	169-173	0. 93-1. 66 (m, 8H), 3. 07-3. 51 (m, 4H), 5. 80-5. 93 (d, 2H), 6. 85-7. 36 (m, 4H), 7. 82-7. 84 (d, 1H), 8. 44-8. 45 (d, 1H)
148	130-134	0. 91-1. 66 (m, 10H), 2. 98-3. 50 (m, 2H), 5. 80-5. 94 (d, 2H), 6. 87-7. 36 (m, 4H), 7. 82-7. 84 (d, 1H), 8. 44-8. 45 (d, 1H)
149	195-196	0. 97-1. 00 (m, 3H), 1. 42-1. 66 (m, 6H), 3. 43-3. 48 (m, 2H), 5. 90-6. 03 (d, 2H), 6. 24 (brs, 1H), 6. 69 (s, 1H), 7. 28-7. 43 (m, 3H), 7. 91-7. 93 (d, 1H), 8. 52-8. 54 (d, 1H), 10. 05 (brs, 1H)
154	251-255	1. 00-1. 80 (m, 10H), 5. 79-5. 96 (d, 2H), 6. 86 (s, 1H), 7. 35-7. 87 (m, 4H), 8. 42-8. 43 (d, 1H)
155	196-199	4. 45-4. 16 (d, 2H), 5. 82-5. 95 (d, 2H), 6. 72 (s, 1H), 7. 19-7. 92 (m, 5H), 8. 42-8. 43 (d, 2H), 8. 94 (s, 1H)
161		2. 98-3. 00 (s, 3H), 5. 87-6. 00 (d, 2H), 6. 37 (s, 1H), 6. 67 (s, 1H), 7. 23-7. 40 (m, 4H), 7. 88-7. 90 (d, 1H), 8. 49-8. 50 (d, 1H), 10. 19 (s, 1H)
163		1. 47 (s, 9H), 5. 88-6. 01 (d, 2H), 6. 01 (s, 1H), 6. 68 (s, 1H), 7. 20-7. 38 (m, 4H), 7. 88-7. 89 (d, 1H), 8. 51-8. 52 (d, 1H), 10. 07 (s, 1H)
180		3. 32 (s, 3H), 3. 49 (s, 3H), 5. 84-5. 97 (d, 2H), 6. 74 (s, 1H), 7. 31-7. 46 (m, 3H), 7. 86-7. 88 (d, 1H), 8. 48-8. 49 (d, 1H), 8. 95 (brs, 1H)
182	129-132	2. 96-2. 97 (s, 3H), 5. 86-6. 00 (d, 2H), 6. 20 (brs, 1H), 7. 02 (s, 1H), 7. 23-7. 39 (m, 3H), 7. 86-7. 88 (d, 1H), 8. 48-8. 49 (d, 1H)
183	130-135	1. 19-1. 23 (t, 3H), 3. 44-3. 49 (m, 2H), 5. 90-6. 03 (d, 2H), 6. 21 (brs, 1H), 7. 00 (s, 1H), 7. 29-7. 43 (m, 3H), 7. 90-7. 92 (d, 1H), 8. 52-8. 53 (d, 1H), 9. 73 (brs, 1H)
184	218-220	0. 90-0. 94 (m, 3H), 1. 49-1. 51 (m, 2H), 3. 30-3. 35 (m, 2H), 5. 83-5. 96 (d, 2H), 6. 16 (brs, 1H), 6. 99 (s, 1H), 7. 19-7. 35 (m, 3H), 7. 82-7. 84 (d, 1H), 8. 43-8. 45 (d, 1H), 9. 82 (brs, 1H)
185	123-126	1. 13-1. 15 (d, 6H), 4. 15-4. 21 (m, 1H), 5. 82-5. 95 (d, 2H), 6. 94-6. 96 (d, 1H), 7. 20-7. 36 (m, 3H), 7. 83-7. 85 (d, 1H), 8. 43-8. 44 (d, 1H)
186	110-113	0. 86-0. 92 (m, 3H), 1. 27-1. 47 (m, 4H), 3. 34-3. 39 (m, 2H), 5. 83-5. 96 (d, 2H), 6. 18 (brs, 1H), 6. 98 (s, 1H), 7. 20-7. 36 (m, 3H), 7. 83-7. 85 (d, 1H), 8. 44-8. 45 (d, 1H)

187	239-243	1. 42(s, 9H), 5. 80-5. 94(d, 2H), 5. 97(brs, 1H), 7. 04-7. 33(m, 4H), 7. 80-7. 82 (d, 1H), 8. 41-8. 42(d, 1H)
188	137-139	0. 54-0. 84(m, 4H), 2. 81-2. 83(m, 1H), 5. 82-5. 96(d, 2H), 6. 31(s, 1H), 6. 99-7. 36(m, 3H), 7. 83-7. 85(d, 1H), 8. 45-8. 47(d, 1H), 9. 68(brs, 1H)
189	220-221	0. 86-0. 90(m, 3H), 1. 30-1. 50(m, 6H), 3. 32-3. 37(m, 2H), 5. 82-5. 96(d, 2H), 6. 18(brs, 1H), 6. 94-7. 35(m, 4H), 7. 82-7. 84(d, 1H), 8. 44- 8. 45(d, 1H), 9. 72(brs, 1H)
190		0. 82-0. 84(m, 3H), 0. 91-1. 61 ((m, 9H), 3. 54-4. 20(m, 1H), 5. 82-5. 95(d, 2H), 7. 02-7. 34(m, 4H), 7. 80-7. 82(d, 1H), 8. 42-8. 43(d, 1H), 10. 00(brs, 1H)
200	226-228	1. 07-1. 86(m, 10H), 3. 83-3. 85(m, 1H), 5. 82-5. 96(d, 2H), 7. 03-7. 34(m, 4H), 7. 81-7. 83(d, 1H), 8. 42-8. 43(d, 1H)
201	166-169	0. 92-1. 28(m, 8H), 2. 85-3. 52(m, 4H), 5. 82-5. 95(d, 2H), 6. 99-7. 33 (m, 4H), 7. 81-7. 82(d, 1H), 8. 42-8. 43(d, 1H)
202	109-113	0. 91-1. 63(m, 10H), 2. 86-3. 73(m, 4H), 5. 81-5. 94(d, 2H), 7. 01-7. 33(m, 4H), 7. 81-7. 83(d, 1H), 8. 41-8. 42(d, 1H)
203	121-124	2. 71(s, 3H), 3. 09(s, 3H), 5. 82-5. 95(d, 2H), 6. 98-7. 35(m, 4H), 7. 83-7. 84(d, 1H), 8. 44-8. 45(d, 1H)
204	219-221	1. 13-1. 72(m, 6H), 2. 96-3. 05(m, 2H), 3. 68-3. 70(m, 2H), 5. 80-5. 93(d, 2H), 6. 98-7. 32(m, 4H), 7. 80-7. 82(d, 1H), 8. 41-8. 42(d, 1H)
205	171-174	0. 92-1. 28(m, 8H), 2. 79-3. 39(m, 4H), 5. 80-5. 93(d, 2H), 6. 92-7. 27 (m, 4H), 7. 81-7. 82(d, 1H), 8. 43-8. 44(d, 1H)
206	225-227	1. 10-1. 90(m, 10H), 3. 83-3. 85(m, 1H), 5. 81-5. 95(d, 2H), 6. 90-7. 36(m, 4H), 7. 82-7. 84(d, 1H), 8. 44-8. 45(d, 1H)
207	223-225	0. 82-0. 84(m, 3H), 0. 96-1. 54 ((m, 9H), 3. 55-4. 15(m, 1H), 5. 81-5. 94(d, 2H), 6. 98-7. 34(m, 4H), 7. 81-7. 82(d, 1H), 8. 43-8. 44(d, 1H)
208	214-216	0. 87-0. 90(m, 3H), 1. 30-1. 51(m, 6H), 3. 29-3. 34(m, 2H), 5. 81-5. 95(d, 2H), 6. 25(brs, 1H), 6. 91-7. 34(m, 4H), 7. 82-7. 84(d, 1H), 8. 44- 8. 45(d, 1H)
209	228-229	0. 48-0. 82(m, 4H), 2. 75-2. 76(m, 1H), 5. 82-5. 95(d, 2H), 6. 41(s, 1H), 6. 94-7. 36(m, 3H), 7. 83-7. 85(d, 1H), 8. 45-8. 47(d, 1H), 10. 01(brs, 1H)
210	215-219	1. 33(s, 9H), 5. 82-5. 95(d, 2H), 6. 04(brs, 1H), 7. 03-7. 35(m, 4H), 7. 82-7. 84(d, 1H), 8. 44-8. 45(d, 1H)
211	180-183	0. 90-0. 94(m, 3H), 1. 27-1. 48(m, 4H), 3. 30-3. 35(m, 2H), 5. 82-5. 95(d, 2H), 6. 27(brs, 1H), 6. 91(s, 1H), 7. 18-7. 32(m, 3H), 7. 83-7. 85 (d, 1H), 8. 45-8. 46(d, 1H)
212	211-214	1. 13-1. 15(d, 6H), 4. 15-4. 21(m, 1H), 5. 82-5. 95(d, 2H), 6. 94-6. 96

		(d, 1H), 7. 20-7. 36 (m, 3H), 7. 83-7. 85 (d, 1H), 8. 43-8. 44 (d, 1H)
213	129-132	1. 14-1. 16 (d, 6H), 4. 13-4. 18 (m, 1H), 5. 82-5. 95 (d, 2H), 6. 04 (brs, 1H), 6. 97 (s, 1H), 7. 14-7. 36 (m, 3H), 7. 83-7. 85 (d, 1H), 8. 45-8. 46 (d, 1H)
214	168-170	2. 67 (s, 3H), 5. 86-5. 99 (d, 2H), 6. 99 (s, 1H), 7. 43-7. 56 (m, 3H), 8. 10-8. 12 (d, 1H), 8. 46-8. 47 (d, 1H)
215	190-193	1. 19-1. 23 (t, 3H), 3. 42-3. 48 (m, 2H), 5. 89-6. 02 (d, 2H), 6. 27 (brs, 1H), 6. 96 (s, 1H), 7. 26-7. 39 (m, 3H), 7. 90-7. 92 (d, 1H), 8. 52-8. 53 (d, 1H), 10. 13 (brs, 1H)
216	211-214	1. 13-1. 15 (d, 6H), 4. 15-4. 21 (m, 1H), 5. 82-5. 95 (d, 2H), 6. 94-6. 96 (d, 1H), 7. 20-7. 36 (m, 3H), 7. 83-7. 85 (d, 1H), 8. 43-8. 44 (d, 1H)
217	218-220	0. 90-0. 94 (m, 3H), 1. 49-1. 51 (m, 2H), 3. 30-3. 35 (m, 2H), 5. 83-5. 96 (d, 2H), 6. 16 (brs, 1H), 6. 99 (s, 1H), 7. 19-7. 35 (m, 3H), 7. 82-7. 84 (d, 1H), 8. 43-8. 45 (d, 1H), 9. 82 (brs, 1H)

索引表 1 和索引表 2 中列举的本发明所述的结构式 (I) 表示的化合物均可根据本专利说明书中所描述的合成方法及合成实施例 1-3 所述的制备方法进行合成。

本发明还提供结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡啶的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物或其农业上适用的盐的用途、一种防治有害生物的农药制剂和一种防治有害生物的方法。

含有本发明所述结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡啶的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物或其农业上适用的盐的有害生物防治剂可用于农作物上的害虫防治, 例如作为在农业园艺领域中成为问题的各种有害生物的防治剂、即农业园艺有害生物防治剂, 或寄生于动物的有害生物防治剂、即动物寄生生物防治剂特别有用。

作为农业园艺用有害生物防治剂, 例如作为杀虫、杀螨剂, 是有用的, 具体地说, 对于防治二斑叶螨、红叶螨、柑桔全爪螨、苹果全爪螨等植物寄生性螨类; 小菜蛾、甘蓝夜蛾、斜纹夜蛾、棉铃虫、烟夜蛾、烟毒蛾、稻纵卷叶野螟、稻褐带卷蛾、苹果小卷蛾、桃小实心蛾、梨小食心虫、小地老虎、马铃薯叶甲、黄守瓜、蚜虫类、粉虱类、蓟马类、蝗虫类、斑潜蝇类等农业害虫类。其中, 含有本发明化合物的农业园艺用有害生物防治剂, 对于农业害虫类等特别有效。另外, 含有本发明所述结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡啶的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物或其农业上适用的盐的农业园艺用有害生物防治剂, 对于防治对有机磷剂、氨基甲酸酯剂、合成除虫菊酯剂等的药剂的各种抗性害虫有效。进而, 本发明所述结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡啶的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物或其农业上适用的盐因为

具有优异的渗透转移性，所以通过使用含有本发明所述结构式 (I) 表示的化合物的农业园艺用有害生物防治剂来处理土壤，在防治土壤有害昆虫类、螨类等类的同时也可防治茎叶部的害虫。

作为含有本发明所述结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物或其农业上适用的盐的有害生物防治剂的其他优选形态，可列举出综合防治上述植物寄生性螨类、农业害虫类、土壤害虫类等的农业园艺用有害生物防治剂。

含有本发明所述结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物或其农业上适用的盐的农业园艺用有害生物防治剂，通常混合该化合物与各种农药上的辅助剂即载体，形成粉剂、颗粒剂、颗粒可湿性粉剂、可湿性粉剂、水性悬浮剂、油性悬浮剂、水溶剂、乳剂、糊剂、气雾剂、微量散布剂等的各种形态的制剂来使用，但只要适合本发明的目的，则可以制成通常在该领域中使用的所有制剂形态。作为制剂中使用的辅助剂，可以列举出硅藻土、消石灰、碳酸钙、滑石、白炭黑、高岭土、膨润土、高岭石和绢云母的混合物、粘土、碳酸钠、小苏打、芒硝、沸石、淀粉等的固体载体；水、甲苯、二甲苯、溶剂石脑油、二噁烷、丙酮、异佛尔酮、甲基异丁基酮、氯苯、环己烷、二甲亚砷、N,N-二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺、N-甲基-2-吡咯烷酮、醇等的溶剂；脂肪酸盐、苯甲酸盐、烷基磺基琥珀酸盐、二烷基磺基琥珀酸盐、聚羧酸盐、烷基硫酸酯盐、烷基硫酸盐、烷基芳基硫酸盐、烷基二甘醇醚硫酸盐、醇硫酸酯盐、烷基磺酸盐、烷基芳基磺酸盐、芳基磺酸盐、木质磺酸盐、烷基二苯基醚二磺酸盐、聚苯乙烯磺酸盐、烷基磷酸酯盐、烷基芳基磷酸盐、芳基磷酸盐、苯乙烯基芳基磷酸盐、聚氧乙烯烷基醚磷酸盐、聚氧乙烯烷基芳基磷酸酯盐、萘磺酸甲醛缩合物的盐这样的阴离子类的表面活性剂或展开剂；脱水山梨糖醇脂肪酸酯、甘油脂肪酸酯、脂肪酸聚甘油酯、脂肪酸醇聚二醇醚、乙炔二醇、炔醇、氧化烯嵌段聚合物、聚氧乙烯烷基醚、聚氧乙烯烷基芳基醚、聚氧乙烯苯乙烯基芳基醚、聚氧乙烯二醇烷基醚、聚乙二醇、聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脱水山梨糖醇脂肪酸酯、聚氧乙烯甘油脂肪酸酯、聚氧乙烯硬化蓖麻油、聚氧丙烯脂肪酸酯这样的非离子类的表面活性剂、展开剂；橄榄油、瓜哇木棉油、蓖麻油、棕榈油、山茶油、椰子油、芝麻油、玉米油、米糠油、落花生油、棉籽油、大豆油、菜籽油、亚麻子油、桐油、液体石蜡等的植物油或矿物油等。这些辅助剂的各种成分，只要不脱离本发明的目的，可以适当选择 1 种或 2 种以上来使用。另外，也可以在上述的辅助剂之外从该领域公知的物质中适当选择使用。也可以使用例如增量剂、增稠剂、防尘降剂、防冻剂、分散稳定剂、药害减轻剂、防霉剂等通常使用的各种辅助剂。

本发明所述结构式 (I) 表示化合物和各种辅助剂即载体的重量配合比例，通常为 0.1: 99.9~90: 10。在实际使用这些制剂时，可以直接使用，或用稀释剂稀释至规定浓度后，根

据需要添加各种展开剂（表面活性剂、植物油、矿物油等）使用。

含有本发明所述结构式（I）表示化合物的农业园艺用有害生物防治剂的施用，根据气象条件、制剂形态、施用时期、施用场所、病虫害的种类或发生状况等的不同而不同，不能一概而定，但是一般以 0.05~800ppm，优选为 0.5~500ppm 的有效成分浓度来进行施用，其每单位的施用量是每 1 公顷本发明化合物为 1~5000g，优选为 10~1000g。另外，作为含有本发明的有害生物防治剂的其他优选形态的农业园艺用有害生物防治剂的施用，可根据上述有害生物防治剂的施用进行。本发明也包含利用这样的施用方法的有害生物的防治方法，特别是植物寄生性螨类、农业害虫类的防治方法。

含有本发明所述结构式（I）表示化合物的农业园艺用有害生物防治剂的各种制剂、或其稀释物的施用，通常可以利用一般进行的施用方法例如散布、喷射、喷雾（misting）、雾化（atomizing）、撒粒、水面施用法、土壤施用（混入、灌注等）、表面施用（涂布、粉衣、被覆等）、浸渍毒饵等来进行。另外，将上述有效成分混合至饲料中给予家畜，也可以阻碍在其排泄物中的害虫、特别是有害昆虫的发生及生育，另外可以利用所谓的超高浓度少量散步法（ultra low volume）施用，在该方法中，可以含有 100% 的活性成分。

另外，含有本发明所述结构式（I）表示化合物可与现有杀虫、杀菌或除草的农药品种的一种或二种或两种以上进行组合进行使用，显示更有益的效果、作用性。特别是混用或合用了本发明所述结构式（I）表示化合物和其他的农药有效成分化合物的 1 种或 2 种以上的混合有害生物防治组合物，可以将适用范围、药剂处理的时期、防治活性等向好的方向改良。另外，本发明化合物和其他的农药的有效成分化合物，可以将分别制成的制剂在散布时混合使用，也可以将两者一起制成制剂使用，本发明也包含这样的混合有害生物防治组合物。

本发明的所述结构式（I）表示化合物及其制剂，具有以下优点：

- （1）本发明首次在吡唑环引入一氟甲氧基，化合物结构具有新颖性；
- （2）本发明的化合物及其制剂具有广谱的杀虫活性：对鳞翅目害虫（小菜蛾、草地贪夜蛾和棉铃虫）、半翅目害虫（桃蚜和苜蓿蚜）、同翅目害虫（水稻褐飞虱）、双翅目害虫（三叶斑潜蝇）以及叶甲类害虫（辣根猿叶甲）都表现出非常良好的活性；
- （3）本发明的化合物及其制剂具有超高的杀虫活性：在 0.16mg/L 剂量下对小菜蛾、草地贪夜蛾和棉铃虫都表现出很好的效果；在 4mg/L 剂量下对蚜虫、三叶斑潜蝇和辣根猿叶甲也都表现出很好的效果；在 20mg/L 剂量下对水稻褐飞虱表现出很好的效果；
- （4）本发明的化合物及其制剂具有很好的安全性，对部分作物如小麦、大豆、棉花、水稻等安全性好，并且对环境具有性；
- （5）本发明的化合物及其制剂具有合理的毒性、生态毒性和环境相容性，属低毒环境友

好型农药。

下面记载本发明的实施例，但是本发明不限于此，首先记载本发明化合物的合成例。

具体实施方式

实施例 1 N-[2-(叔丁基氨基甲酰基)-4-氯-6-甲基-苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-一氟甲氧基-1H-吡啶-5-甲酰胺的合成(化合物 8)

第一步：3-一氟甲氧基-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡啶-5-甲酸的合成

在 500ml 三口圆底烧瓶中，依次加入 1-(3-氯-2-吡啶基)-3-羟基-1H-吡啶-5-甲酸乙酯 (13.35g, 0.05mol)，300ml 乙腈，固体碳酸钾 (8.28g, 0.06mol)，一氟一溴甲烷 (8.48g, 0.075mol)，然后加热回流，反应至原料完全消失，冷却至室温，过滤，滤饼用乙腈 2*50ml 淋洗，滤液浓缩后加 200ml 甲醇使之溶解，然后在室温慢慢向其中滴加含氢氧化钠 (2.4g, 0.06mol) 的 50ml 水溶液，室温搅拌约 30min 后，反应完全，蒸除溶剂，加水，用乙醚 2*50ml 萃取，水相加稀盐酸调 PH 值显酸性，体系有大量的白色固体生成，过滤，红外灯干燥，得 3-一氟甲氧基-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡啶-5-甲酸 11.05g，熔点 149-151°C，收率为 81.6%；¹HNMR (400MHz, DMSO-d₆) δ 5.84-5.98 (d, 2H), 6.74 (s, 1H), 7.62-7.65 (m, 1H), 8.19-8.21 (d, 1H), 8.53-8.54 (d, 1H), 13.65 (br, 1H); M(%): 270(100)。

第二步：6-氯-2-[3-一氟甲氧基-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-5-吡啶基]-8-甲基-4H-[d][1,3]苯并噁嗪-4-酮的合成

在 250ml 三口圆底烧瓶中，3-一氟甲氧基-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡啶-5-甲酸 (3g, 0.011mol) (实施例 1-合成第一步产物)，2-氨基-5-氯-3-甲基苯甲酸 (2.04g, 0.011mol)，乙腈 150ml，吡啶 7ml，搅拌使固体全部溶解，将体系冷却，在 -5°~-10° 滴加甲基磺酰氯 (2ml, 2.96g, 0.026mol) / 乙腈 20ml 溶液，滴加完毕后，保持在 -5°~-10° 反应 1h，然后自然升至室温反应 3h，反应完全后，加水 30ml，搅拌 30min，过滤，滤饼先后用 2:1 乙腈/水 (2*40ml)、乙腈 (2*20ml) 及乙醚 (2*20ml) 淋洗，得第一批固体；滤液蒸除溶剂后，加水，用乙酸乙酯 (3*40ml) 萃取，有机相用无水硫酸钠干燥、过滤、浓缩后，用乙醇进行重结晶，得第二批固体，两批固体合并，得 6-氯-2-[3-一氟甲氧基-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-5-吡啶基]-8-甲基-4H-[d][1,3]苯并噁嗪-4-酮 4.17g，熔点 206.0-207.5°C，收率为 84.22%；¹HNMR (400MHz, CDCl₃) δ 1.81(s,3H),5.83-5.97(d,2H), 6.85(s,1H), 7.46-7.49(m,2H), 7.84-7.99(m,2H), 8.54-8.56(d, 1H); M(%): 421.0(100)。

第三步：2-(3-氯-2-吡啶基)-5-一氟甲氧基-2H-吡啶-(2-叔丁基氨基甲酰基-4-氯-6-甲基

-苯基) 3-甲酰胺的合成

在 50ml 单口圆底烧瓶中, 向 6-氯-2-[3-氟甲氧基-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-5-吡啶基]-8-甲基-4H-[d][1,3]苯并噁嗪-4-酮 (1g, 0.00238mol) (实施例 1-合成第二步产物) 的四氢呋喃溶液中慢慢滴加叔丁胺 (0.21g, 0.00286mol), 室温搅拌过夜后, 反应完全, 减压蒸除四氢呋喃, 残余物中加少许乙醇, 搅拌数分钟后, 过滤, 得白色固体 1.02 g, 即为 2-(3-氯-2-吡啶基)-5-氟甲氧基-2H-吡啶-(2-叔丁氨基甲酰基-4-氯-6-甲基-苯基) 3-甲酰胺, 熔点 227.0-228.0°C, 收率为 87.6%; $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, DMSO-d_6) δ 1.26(s,9H), 2.16(s,3H), 5.84-5.98(d,2H), 6.93(s,1H), 7.26-7.58(m,4H), 8.10-8.13(m,1H), 8.45-8.46(d, 1H), 10.10(s,1H); M (%): 492.5(100)。

实施例 2 N-[2-(甲氨基甲酰基)-4-氯-6-甲基-苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-氟甲氧基-1H-吡啶-5-甲酰胺的合成 (化合物 3)

在 50ml 单口圆底烧瓶中, 向 6-氯-2-[3-氟甲氧基-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-5-吡啶基]-8-甲基-4H-[d][1,3]苯并噁嗪-4-酮 (1g, 0.00238mol) (实施例 1-合成第二步产物) 的四氢呋喃溶液中加入甲胺盐酸盐 (0.19g, 0.00286mol) 及无水醋酸钠 (0.24g, 0.00286mol), 室温搅拌过夜后, 反应完全, 减压蒸除四氢呋喃, 残余物中加水, 用乙酸乙酯萃取, 有机相用无水硫酸钠干燥, 过滤, 浓缩得粗品, 用乙醇进行重结晶得白色固体 0.87 g, 即为 N-[2-(甲氨基甲酰基)-4-氯-6-甲基-苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-氟甲氧基-1H-吡啶-5-甲酰胺, 熔点 236.0-237.4°C, 收率为 82.7%; $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, DMSO-d_6) δ 2.18(s,3H), 2.93-2.94(d, 2H), 5.83-5.96(d, 2H), 6.16-6.17(d,1H), 6.70(s,1H), 7.20-7.36(m,4H), 7.82-7.84(d,1H), 8.44-8.45(d, 1H), 9.96(s,1H); M (%): 450.0(100)。

实施例 3 N-[2-(乙氨基甲酰基)-4-氰基-6-甲基-苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-氟甲氧基-1H-吡啶-5-甲酰胺的合成 (化合物 33)

第一步: 6-氰基-2-[3-氟甲氧基-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-5-吡啶基]-8-甲基-4H-[d][1,3]苯并噁嗪-4-酮的合成

在 250ml 三口圆底烧瓶中, 3-氟甲氧基-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡啶-5-甲酸 (5g, 0.0185mol) (实施例 1-合成第一步产物), 2-氨基-5-氰基-3-甲基苯甲酸 (3.24g, 0.0185mol), 乙腈 150ml, 吡啶 15ml, 搅拌使固体全部溶解, 将体系冷却, 在 $-5^\circ\sim-10^\circ$ 滴加甲基磺酰氯 (4ml,

5.98g, 0.052mol) / 乙腈 20ml 溶液, 滴加完毕后, 保持在 $-5^{\circ}\sim-10^{\circ}$ 反应 1h, 然后自然升至室温反应 3h, 反应完全后, 加水 30ml, 搅拌 30min, 过滤, 滤饼先后用 2:1 乙腈/水 (2*40ml)、乙腈 (2*30ml) 及乙醚 (2*30ml) 淋洗, 得第一批固体; 滤液蒸除溶剂后, 加水, 用乙酸乙酯 (3*40ml) 萃取, 有机相用无水硫酸钠干燥、过滤、浓缩后, 用乙醇进行重结晶, 得第二批固体, 两批固体合并, 得淡黄色固体 4.17g, 即为 6-氰基-2-[3-氟甲氧基-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-5-吡唑基]-8-甲基-4H-[d][1,3] 苯并噁嗪-4-酮, 熔点 $208.5\sim 211.0^{\circ}\text{C}$, 收率为 54.87%; $^1\text{H NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ 1.86(s,3H), 5.84-5.97(d,2H), 6.90(s,1H), 7.27-7.98(m,3H), 8.32(s,1H), 8.55-8.56(d,1H); M(%): 411.1(100)。

第二步: N-[2-(乙氨基甲酰基)-4-氰基-6-甲基-苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-氟甲氧基-1H-吡唑-5-甲酰胺的合成

在 50ml 单口圆底烧瓶中, 向 6-氰基-2-[3-氟甲氧基-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-5-吡唑基]-8-甲基-4H-[d][1,3] 苯并噁嗪-4-酮 (0.4g, 0.00097mol) (实施例 3-合成第一步产物) 的四氢呋喃溶液中慢慢滴加乙胺 (65-70%, 0.083g, 0.0012mol), 室温搅拌过夜后, 反应完全, 减压蒸除四氢呋喃, 残余物中加少许乙醇, 搅拌数分钟后, 过滤, 得浅灰色固体 0.35g, 即为 N-[2-(乙氨基甲酰基)-4-氰基-6-甲基-苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-氟甲氧基-1H-吡唑-5-甲酰胺, 熔点 $151.0\sim 152.5^{\circ}\text{C}$, 收率为 78.6%; $^1\text{H NMR}$ (400MHz, DMSO-d_6) δ 1.23-1.27(m,3H), 2.26(s,3H), 3.45-3.48(m,2H), 5.84-5.98(d,2H), 6.23(s,1H), 6.64(s,1H), 7.36-8.48(m,5H), 10.52(s,1H); M (%): 457.1(100)。

以下实施例 4 至实施例 6 给出以本发明的化合物 (I) 作为活性物质组份, 加工配制几种杀虫剂剂型的实际例子, 需要指出的是本发明并不仅仅局限在下述实例的范围内。在这些配方例子中, 所有的“%”均指重量百分比。

实施例 4 可湿性粉剂配方

将 15% 的化合物 (8) (索引表 1)、3% 的木质素磺酸钠盐 (M_q)、2% 的月桂醇聚氧乙烯醚 (JFC)、40% 的硅藻土和 40% 的轻质碳酸钙充分地混合, 经超细粉碎机粉碎, 即得到 15% 可湿性粉剂产品。

实施例 5 乳油配方

将 10% 的化合物 (8) (索引表 1)、5% 的农乳 500 号 (钙盐)、5% 的农乳 602 号、5% 的 N-甲基-2-吡咯烷酮和 75% 的二甲苯加热搅拌均匀, 即得 10% 的乳油产品。

实施例 6 水分散粒剂配方

将 60%的化合物 (8) (索引表 1)、2%的聚乙烯吡咯烷酮、12%的萘磺酸钠甲醛缩合物、8%的 N-甲基-N-油酰基-牛磺酸钠、2%的羧甲基纤维素、和 16%的高岭土均匀地混合, 粉碎, 再加水捏合后, 加入 10—100 目筛网的造粒机中进行造粒, 然后再经干燥、筛分 (筛网范围)。即得 60%的水分散粒剂产品。

以下实施例 7 至实施例 14 给出下面给出使用本发明的化合物进行生物活性测定的实例, 需要指出的是本发明并不仅仅局限在下述实例的范围内。

杀虫活性评价试验根据下列方法进行:

待测化合物用丙酮/甲醇 (1: 1) 的混合溶剂溶解后, 用含有 0.1%吐温 80 的蒸馏水稀释至所需的浓度。

试验靶标为小菜蛾 (*Plutella xylostella*)、草地贪夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*)、棉铃虫 (*Heliothis armigera*)、苜蓿蚜 (*Aphis medicaginis*)、桃蚜 (*Myzus persicae*)、水稻褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*)、三叶斑潜蝇 (*Liriomyza trifolii*) 和辣根猿叶甲 (*Phaedon cochleariae*)。

以下 “mg/L” 均指每毫克活性物/升。

试验统计: 统计各个处理的死虫数和活虫数, 计算死亡率。

$$\text{死亡率 (\%)} = \frac{\text{试虫数} - \text{药后活虫数}}{\text{试虫数}} \times 100$$

注: 生物活性测定实施例所述的编号与索引表 1 和索引表 2 所述的化合物编号相对应。

实施例 7 对于小菜蛾 (*Plutella xylostella*) 的效果试验

将甘蓝片剪下, 打孔成圆片, 然后浸于药液中 20s, 放于 $\Phi 9\text{cm}$ 塑料培养皿内 (5 片/皿), 接小菜蛾 2 龄幼虫 15 头/皿, 放一张滤纸, 加盖。置于 26℃室内培养, 72h 后检查结果。试验重复 4 次。以尖头镊子轻触虫体, 无反应视为死虫。根据上述死亡率计算公式计算死亡率。异常虫也看作死亡。索引表 1 中化合物 1-27、33-63、85-86、89、93、99-106、110-112 在 4mg/L 时得到了 100%的死亡率。另外化合物 1、3、4、8、33、49-51、57-58、59、83、89、101、103、106 在 0.16mg/L 时得到了至少 80%的死亡率。

实施例 8 对于草地贪夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*) 的效果试验

将盆栽棉花（2-3 张叶龄）进行药剂喷雾处理，晾干。放入培养室继续正常培养。在 5、12、19d 后用剪刀将叶片剪下，放于 $\Phi 9\text{cm}$ 塑料培养皿内，接草地贪夜蛾幼虫，放一张滤纸，加盖。置于观察室内，6d 后检查结果。根据上述死亡率计算公式计算死亡率。异常虫也看作死亡。索引表 1 中化合物 3、8、10、33、49、50、51 在 4mg/L 时得到了 100% 的死亡率。化合物 3、8、33、51 在 0.8mg/L 时得到了至少 90% 的死亡率。化合物 8、33、51 在 0.16mg/L 时得到了至少 80% 的死亡率。

实施例 9 对于棉铃虫 (*Heliothis armigera*) 的效果试验

将盆栽棉花（2-3 张叶龄）进行药剂喷雾处理，晾干。放入培养室继续正常培养。在 5、12、19d 后用剪刀将叶片剪下，放于 $\Phi 9\text{cm}$ 塑料培养皿内，接棉铃虫幼虫，放一张滤纸，加盖。置于观察室内，6d 后检查结果。根据上述死亡率计算公式计算死亡率。异常虫也看作死亡。索引表 1 中化合物 3、8、10、33、36、49、51 在 20mg/L 时得到了 100% 的死亡率。化合物 8、10、33、51 在 4mg/L 时得到了 100% 的死亡率。化合物 8 在 0.16mg/L 时得到了 100% 的死亡率。

实施例 10 对于苜蓿蚜 (*Aphis medicaginis*) 的效果试验

将蚕豆叶片剪去两端，背面朝上放在小块棉花上，置于培养皿内，加少量水，接苜蓿蚜成蚜以产若蚜。24h 后去除成蚜，继续培养 2d 后将叶片在药液中浸润 5s 后置于棉花上，晾干。24h 后检查结果。根据上述死亡率计算公式计算死亡率。异常虫也看作死亡。索引表 1 中化合物 3、8、10、33-37、39、27、47、51、83、85、89、95、101 在 20mg/L 时得到了至少 90% 的死亡率。化合物 3、8、33、34、35、36、51、83、101 在 4mg/L 时得到了至少 80% 的死亡率。

实施例 11 对于桃蚜 (*Myzus persicae*) 的效果试验

将盆栽甘蓝（3-4 张叶龄）进行药剂喷雾处理，晾干。放入培养室继续正常培养。在 5、12、19d 后用分别接入桃蚜若虫。置于观察室内，7-10d 后检查结果。根据上述死亡率计算公式计算死亡率。异常虫也看作死亡。索引表 1 中化合物 3、8、10、33、51 在 20mg/L 时得到了 100% 的死亡率。化合物 3、8、33、51 在 4mg/L 时得到了至少 90% 的死亡率。

实施例 12 对于水稻褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*) 的效果试验

将水稻苗用白石英沙固定于培养皿内，接用 CO_2 麻醉 3 龄中期若虫，置于 POTTER 喷雾塔

下喷雾。喷雾后用透明塑料杯罩住，标记后放于观察室内。72h 后检查结果。试验重复 4 次。以尖头镊子轻触虫体，无反应视为死虫。根据上述死亡率计算公式计算死亡率。异常虫也看作死亡。索引表 1 中化合物 8、33、36、51-53、57、58 在 100mg/L 时得到了至少 90% 的死亡率。化合物 8、33、51 在 20mg/L 时得到了至少 80% 的死亡率。

实施例 13 对于三叶斑潜蝇 (*Liriomyza Trifolii*) 的效果试验

将盆栽蚕豆 (3-4 张叶龄) 进行药剂喷雾处理，晾干。放入培养室继续正常培养。在 5、12、19d 后用分别接入三叶斑潜蝇幼虫。置于观察室内，7d 后检查结果。根据上述死亡率计算公式计算死亡率。异常虫也看作死亡。索引表 1 中化合物 8、9、10、33、36、49、51 在 20mg/L 时得到了 100% 的死亡率。化合物 8、10、49、51 在 4mg/L 时得到了 100% 的死亡率。

实施例 14 对于辣根猿叶甲 (*Phaedon cochleariae*) 的效果试验

将盆栽甘蓝 (3-4 张叶龄) 进行药剂喷雾处理，晾干。放入培养室继续正常培养。在 5、12、19d 后用剪刀将叶片剪下，放于 Φ 9cm 塑料培养皿内，接辣根猿叶甲或小菜蛾 2 龄幼虫，放一张滤纸，加盖。置于观察室内，6-7d 后检查结果。根据上述死亡率计算公式计算死亡率。异常虫也看作死亡。索引表 1 中化合物 3、8、10、33、36、49、51 在 20mg/L 时得到了 100% 的死亡率。化合物 3、8、33、51 在 4mg/L 时得到了至少 90% 的死亡率。化合物 8 在 0.8mg/L 时得到了至少 90% 的死亡率。

按照以上方法，选取化合物 8 和已知化合物氯虫酰胺进行了杀小菜蛾、苜蓿蚜和水稻褐飞虱活性的平行测定。结果见表 3。

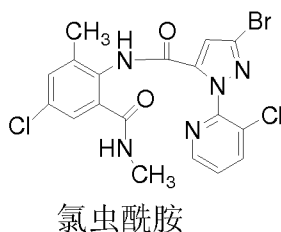


表 3 化合物 8 和已知化合物氯虫酰胺的活性平行比较 (死亡率, %)

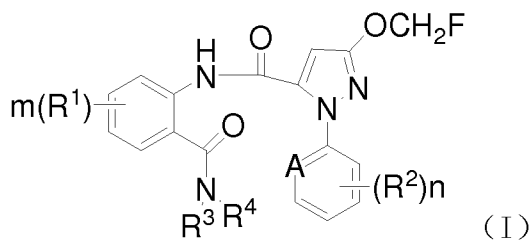
化合物编号	浓度 (mg/L)	小菜蛾	浓度 (mg/L)	苜蓿蚜	浓度 (mg/L)	水稻褐飞虱
8 (实施例 1)	0.8	100	20	100	100	100
	0.16	100	4	90	20	80
	0.032	80	0.8	30	4	0
氯虫酰胺	0.8	100	20	70	100	80
	0.16	80	4	0	20	10

	0.032	20	0.8	0	4	0
--	-------	----	-----	---	---	---

结论：分别在 0.16mg/L 剂量下对鳞翅目害虫小菜蛾，在 4mg/L 剂量下对半翅目害虫苜蓿蚜，在 20mg/L 剂量下对同翅目害虫水稻褐飞虱；本发明化合物 8（实施例 1）的杀虫活性明显优于已知化合物氯虫酰胺。

权利要求书

1、一种结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物或其农业上适用的盐，



其中：

A 为 N 或 CH；

R^1 为氢、卤素、氰基、硝基、烷基、卤代烷基、氰基烷基、链烯基、卤代链烯基、炔基、卤代炔基、烷氧基、氰基烷氧基、卤代烷氧基、烷硫基、卤代烷硫基、烷基磺酰基、烷基羰基、卤代烷基羰基、烷氧基羰基、卤代烷氧基羰基或氨基烷基；

R^2 为氢、卤素、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基或氰基；

R^3 为氢、烷基或烷氧基；

R^4 为氢、氰基、烷基、烷氧基、烷氨基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代烷氨基、氰基烷基、环烷基、卤代环烷基、羟烷基、烷氧羰基甲基、烷氧基酰胺基、烷基酰胺基、卤代烷基酰胺基、氰基取代的烷基酰胺基或芳杂环甲基；

或者 R^3 和 R^4 与所连接的 N 一起形成三元、四元、五元或六元环；

m 为 0~4 的整数；

n 为 0~4 的整数。

2、按照权利要求 1 所述的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物，其特征在于所述结构式 (I) 中：

R^1 为氢、卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、氰基 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、卤代 C_3 - C_6 炔基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 氰基烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 卤代烷硫基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基、 C_1 - C_6 烷基羰基、卤代 C_1 - C_6 烷基羰基、 C_1 - C_6 烷氧基羰基、卤代 C_1 - C_6 烷氧基羰基或氨基 C_1 - C_6 烷基；

R^2 为氢、卤素、 C_1 - C_6 烷基、卤代 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、卤代 C_1 - C_6 烷氧基或氰基；

R^3 为氢或 C_1 - C_3 烷基；

R^4 为氢、氰基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷氨基、卤代 C_1 - C_6 烷基、卤代 C_1 - C_6 烷氧

基、卤代 C₁-C₆ 烷基氨基、氰基 C₁-C₆ 烷基、C₃-C₆ 环烷基、卤代 C₃-C₆ 环烷基、羟 C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷氧羰基甲基、C₁-C₆ 烷氧基酰胺基、C₁-C₆ 烷基酰胺基、卤代 C₁-C₆ 烷基酰胺基、氰基取代的 C₁-C₆ 烷基酰胺基或芳杂环甲基；

m 为 2；

n 为 1。

3、按照权利要求 2 所述的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物，其特征在于所述结构式 (I) 中：

A 为 N；

R¹ 为氢、卤素、氰基、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基或 C₁-C₆ 烷基羰基；

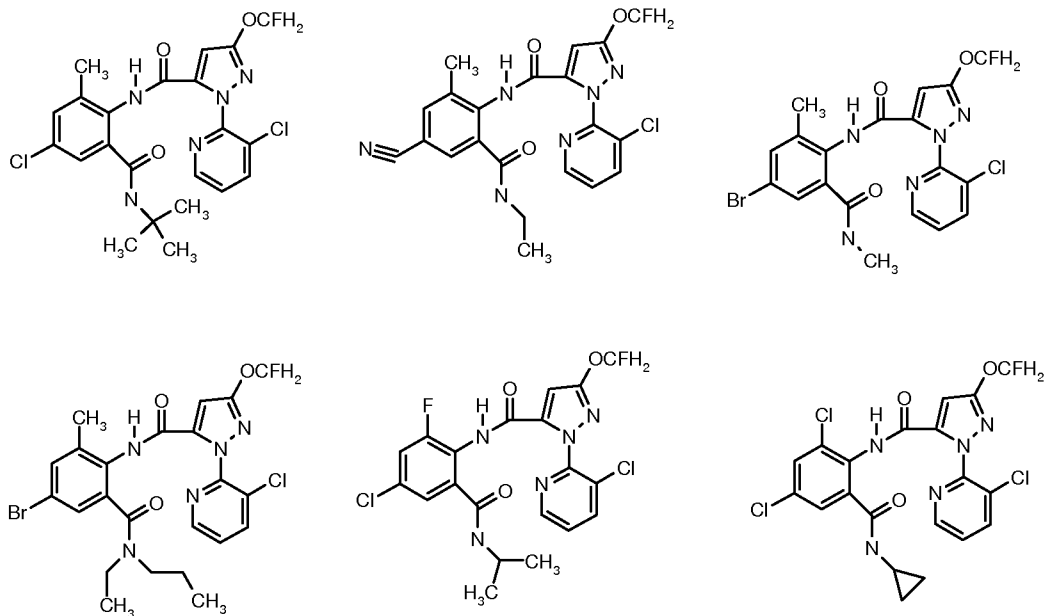
R² 为卤素、氰基、C₁-C₆ 烷基或卤代 C₁-C₃ 烷基。

4、按照权利要求 3 所述的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物，其特征在于所述结构式 (I) 中：

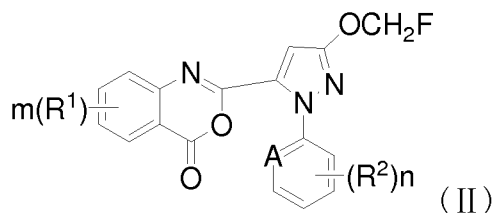
R¹ 为氢、卤素、氰基、甲基或三氟甲基；

R² 为卤素或氰基。

5、按照权利要求 4 所述的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物，其特征在于所述的结构式 (I) 化合物为：



6、一种制备按照权利要求 1 至 5 之一所述的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物的中间体，其特征在于具有如下结构式 (II)：



其中：

A 为 N 或 CH；

R^1 为氢、卤素、氰基、硝基、烷基、卤代烷基、氰基烷基、链烯基、卤代链烯基、炔基、卤代炔基、烷氧基、氰基烷氧基、卤代烷氧基、烷硫基、卤代烷硫基、烷基磺酰基、烷基羰基、卤代烷基羰基、烷氧基羰基、卤代烷氧基羰基或氨基烷基；

R^2 为氢、卤素、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基或氰基；

m 为 0~4 的整数；

n 为 0~4 的整数。

7、按照权利要求 6 所述的制备按照权利要求 1 至 5 之一所述的含一氟甲氧基吡啶的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物的中间体，其特征在于结构式 (II) 中：

A 为 N；

R^1 为氢、卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、氰基 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 链烯基、 C_2 - C_6 卤代链烯基、 C_2 - C_6 炔基、卤代 C_3 - C_6 炔基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 氰基烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 卤代烷硫基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基、 C_1 - C_6 烷基羰基、卤代 C_1 - C_6 烷基羰基、 C_1 - C_6 烷氧基羰基、卤代 C_1 - C_6 烷氧基羰基或氨基 C_1 - C_6 烷基；

R^2 为氢、卤素、 C_1 - C_6 烷基、卤代 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、卤代 C_1 - C_6 烷氧基或氰基；

m 为 2；

n 为 1。

8、按照权利要求 7 所述的制备按照权利要求 1 至 5 之一所述的含一氟甲氧基吡啶的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物的中间体，其特征在于结构式 (II) 中：

R^1 为氢、卤素、氰基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基或 C_1 - C_6 烷基羰基；

R^2 为卤素、氰基、 C_1 - C_6 烷基或卤代 C_1 - C_3 烷基。

9、按照权利要求 8 所述的制备按照权利要求 1 至 5 之一所述的含一氟甲氧基吡啶的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物的中间体，其特征在于结构式 (II) 中：

R^1 为氢、卤素、氰基、甲基或三氟甲基；

R^2 为卤素或氰基。

10、一种按照权利要求 1 所述的含一氟甲氧基吡啶的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物合成

方法，其特征在于按照如下步骤：

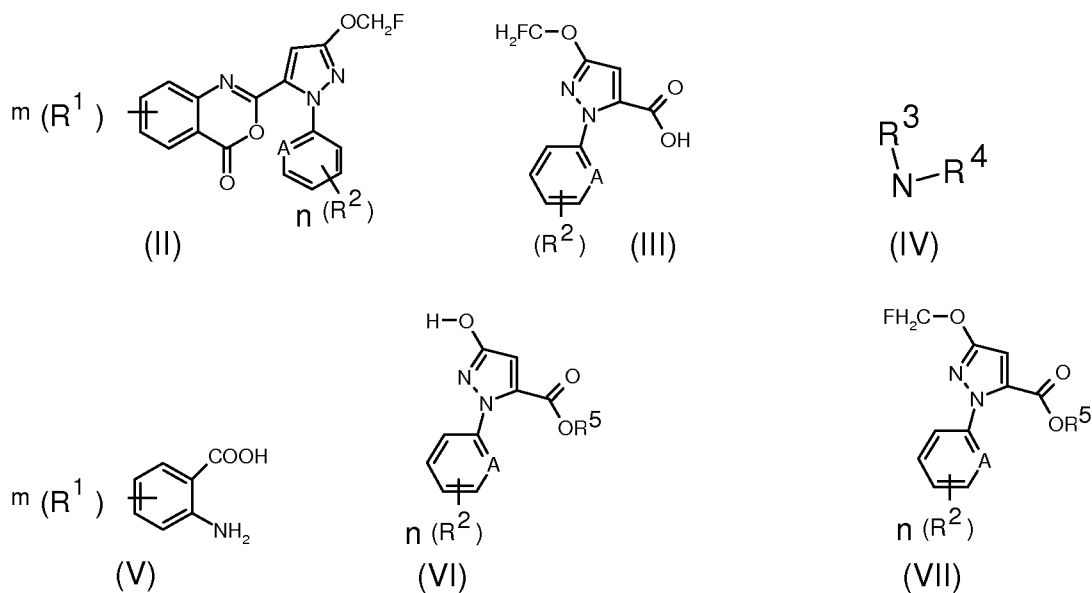
(1) 在非质子性溶剂中，结构式 (VI) 表示的化合物与一氟一溴甲烷在缚酸剂作用下，反应得到结构式 (VII) 表示化合物；

(2) 在质子性溶剂中，结构式 (VII) 表示化合物在碱作用下水解得到结构式 (III) 表示的含一氟甲氧基吡唑羧酸；

(3) 在非质子性溶剂中，加入碱和烷基磺酰氯，结构式 (III) 表示的含一氟甲氧基吡唑羧酸和结构式 (V) 表示的取代邻氨基苯甲酸反应得结构式 (II) 表示的含一氟甲氧基吡唑的 4H-苯并[1,3]噁嗪-4-酮类化合物；

(4) 在非质子性溶剂中，结构式 (II) 表示的含一氟甲氧基吡唑的 4H-苯并[1,3]噁嗪-4-酮类化合物和结构式 (IV) 表示的化合物反应得结构式 (I) 表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物；

其中结构式 (II)、(III)、(IV)、(V)、(VI) 和 (VII) 表示的化合物如下：



A、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^5 基团以及m和n的定义如权利要求1。

11、按照权利要求10所述的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物合成方法，其特征在于：

步骤(1)中所述结构式(VI)表示的化合物与一氟一溴甲烷和缚酸剂的投料物质的量比为1:1.1~2:1.1~2，所述非质子性溶剂选自四氢呋喃、乙腈、1,4-二氧六环或丙酮中的一种或两种以上组合，反应温度为10~90℃；

步骤(2)中所述结构式(VII)表示化合物与碱的投料物质的量比为1:1~1.5，所述质子性溶剂为甲醇和/或乙醇，反应温度为10~90℃；

步骤(3)中所述结构式(III)表示的含一氟甲氧基吡唑羧酸和结构式(V)表示的取代

邻氨基苯甲酸及烷基磺酰氯的投料物质的量比为 1: 1~1.5: 2~3, 所述烷基磺酰氯为甲基磺酰氯, 所述非质子性溶剂选自四氢呋喃、乙腈、1, 4-二氧六环、乙醚或甲苯中的一种或两种以上组合, 所述碱为有机碱, 反应温度为-30~80°C;

步骤(4)中所述结构式(II)表示的含一氟甲氧基吡唑的4H-苯并[1,3]噁嗪-4-酮类化合物和结构式(IV)表示的化合物的投料物质的量比为 1: 1~5, 所述非质子性溶剂选自四氢呋喃、乙腈、1, 4-二氧六环、乙醚、甲苯、二氯甲烷或氯仿中的一种或两种以上组合。

12、按照权利要求11所述的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物合成方法, 其特征在于:

步骤(1)中所述结构式(VI)表示的化合物与一氟一溴甲烷和缚酸剂的投料物质的量比为 1: 1.1~1.5: 1.1~1.5, 反应温度为 20~80°C;

步骤(2)中所述结构式(VII)表示化合物与碱的投料物质的量比为 1: 1~1.2, 反应温度为 20~80°C;

步骤(3)中所述结构式(III)表示的含一氟甲氧基吡唑羧酸和结构式(V)表示的取代邻氨基苯甲酸及烷基磺酰氯的投料物质的量比为 1: 1~1.2: 2~2.5, 所述有机碱选自三乙胺、吡啶或3-甲基吡啶中的一种或两种以上组合, 反应温度为-15~30°C;

步骤(4)中所述结构式(II)表示的含一氟甲氧基吡唑的4H-苯并[1,3]噁嗪-4-酮类化合物和结构式(IV)表示的化合物的投料物质的量比为 1: 1~2。

13、一种如权利要求1至12之一所述的结构式(I)表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物或其农业上适用的盐的用途, 其特征在于结构(I)化合物用于农作物上的害虫防治。

14、一种防治有害生物的农药制剂, 其特征在于: 含有按照权利要求1所述的结构式(I)表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物或其盐作为活性成分和农业、林业、卫生上可接受的载体, 其中活性成分与载体的重量配比为 0.1: 99.9~90: 10。

15、一种防治有害生物的方法, 其特征在于: 将权利要求14所述的农药制剂施于需要控制的有害生物或其生长的介质上, 其中活性成分的有效量为每公顷 10 克到 1000 克。

16、一种防治有害生物的方法, 其特征在于: 含有按照权利要求1所述的结构式(I)表示的含一氟甲氧基吡唑的邻甲酰氨基苯甲酰胺类化合物与现有杀虫、杀菌或除草的农药品种的一种或二种或两种以上进行组合使用。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/CN2011/073810

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

(see the extra sheet)

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC: C07D401/-, C07D231/-, C07D413/-, A01N43/-, A01P7/-

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CPRSABS, VEN, CNKI, STN

Fluoro, anthranilamide, anthranilic diamide, insecticide, pesticide, pest, ryanodine receptor

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
PX	CN101967139A(SINOCHEM LANTIAN CO.LTD, ET AL.), 09 Feb. 2011(09.02. 2011), claims 1-16	1-16
X	CN101298435A (SINOCHEM GROUP CO. LTD, ET AL.), 05 Nov. 2008(05.11.2008), compounds of I-7, I-19, I-59, I-88 of table 1, pages 35-37, 40 of the description, claims 1-5	1-9, 13-16
Y	pages 34-35 of the description	10-12

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

“A” document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

“E” earlier application or patent but published on or after the international filing date

“L” document which may throw doubts on priority claim (S) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

“O” document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

“P” document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

“T” later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

“X” document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

“Y” document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

“&”document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

29 May 2011(29.05.2011)

Date of mailing of the international search report

18 Aug. 2011 (18.08.2011)

Name and mailing address of the ISA/CN
The State Intellectual Property Office, the P.R.China
6 Xitucheng Rd., Jimen Bridge, Haidian District, Beijing, China
100088
Facsimile No. 86-10-62019451

Authorized officer

TIAN, Dingding

Telephone No. (86-10)62086303

INTERNATIONAL SEARCH REPORTInternational application No.
PCT/CN2011/073810

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO2005118552A2(E.I.DUPONT DE NEMOURS AND COMPANY), 15 Dec. 2005 (15.12.2005), schemes 11, 12, 3 and 1 in the description	10-12
A	WO2004046129A2(E.I.DUPONT DE NEMOURS AND COMPANY), 03 Jun. 2004 (03.06.2004), the whole description	1-16

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.
PCT/CN2011/073810

Patent Documents referred in the Report	Publication Date	Patent Family	Publication Date
CN101298435A	05.11.2008	WO2008134970A	13.11.2008
WO2005118552A2	15.12.2005	KR20060135881A	29.12.2006
		BR200509413A	04.09.2007
		TW200604180A	01.02.2006
		EP1751112A2	14.02.2007
		JP2007532661T	15.11.2007
		US2007184018A1	09.08.2007
		CN1972915A	30.05.2007
		AU2005250328A1	15.12.2005
		MX2006011776A1	01.01.2007
		WO2005118552A3	26.01.2006
		IN200604977P1	17.08.2007
CN101967139A	09.02.2011	none	
WO2004046129A2	03.06.2004	US7666882B2	23.02.2010
		US2006014808 A1	19.01.2006
		IN200501374P1P1	24.12.2010
		BR0315714A	06.09.2005
		MX263285B	17.12.2008
		EP1560820B1	26.05.2010
		JP4648705B2	09.03.2011
		CN100486975C	13.05.2009
		EP1560820A2	10.08.2005
		JP2006514632T	11.05.2006
		AU2003295491B2	08.10.2009
		AU200329549 A1	15.06.2004
		KR20050075001A	19.07.2005
		DE60332753D1	08.07.2010
		CN1711255A	21.12.2005
WO2004046129A3	15.07.2004		

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/CN2011/073810

CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D401/04 (2006.01) i

C07D401/14 (2006.01) i

C07D413/14 (2006.01) i

C07D231/22 (2006.01) i

C07D413/12 (2006.01) i

A01N43/56 (2006.01) i

A01P7/04 (2006.01) i

A01P7/02 (2006.01) i

<p>A.主题的分类</p> <p>(参见附加页)</p> <p>按照国际专利分类(IPC)或者同时按照国家分类和 IPC 两种分类</p>														
<p>B.检索领域</p> <p>检索的最低限度文献(标明分类系统和分类号)</p> <p>IPC: C07D401/-、C07D231/-、C07D413/-、A01N43/-、A01P7/-</p> <p>包含在检索领域中的除最低限度文献以外的检索文献</p> <p>在国际检索时查阅的电子数据库(数据库的名称, 和使用的检索词(如使用))</p> <p>CPRSABS、VEN、CNKI、STN</p> <p>氟甲氧基、邻甲酰氨基苯甲酰胺、邻氨基、苯甲酰胺、杀虫剂、害虫、鱼尼丁受体、中化蓝天</p> <p>fluoro、anthranilamide、anthranilic diamide、insecticide、pesticide、pest、ryanodine receptor</p>														
<p>C.相关文件</p> <table border="1"> <thead> <tr> <th>类型*</th> <th>引用文件, 必要时, 指明相关段落</th> <th>相关的权利要求</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>PX</td> <td>CN101967139A (中化蓝天集团有限公司 等), 09.2 月 2011 (09.02.2011), 权利要求 1-16</td> <td>1-16</td> </tr> <tr> <td>X</td> <td>CN101298435A (中国中化集团公司 等), 05.11 月 2008 (05.11.2008) 说明书表格 1 的化合物 I-7、I-19、I-59、I-88, 第 35-37、40 页, 权利要求 1-5</td> <td>1-9, 13-16</td> </tr> <tr> <td>Y</td> <td>说明书第 34-35 页</td> <td>10-12</td> </tr> </tbody> </table>			类型*	引用文件, 必要时, 指明相关段落	相关的权利要求	PX	CN101967139A (中化蓝天集团有限公司 等), 09.2 月 2011 (09.02.2011), 权利要求 1-16	1-16	X	CN101298435A (中国中化集团公司 等), 05.11 月 2008 (05.11.2008) 说明书表格 1 的化合物 I-7、I-19、I-59、I-88, 第 35-37、40 页, 权利要求 1-5	1-9, 13-16	Y	说明书第 34-35 页	10-12
类型*	引用文件, 必要时, 指明相关段落	相关的权利要求												
PX	CN101967139A (中化蓝天集团有限公司 等), 09.2 月 2011 (09.02.2011), 权利要求 1-16	1-16												
X	CN101298435A (中国中化集团公司 等), 05.11 月 2008 (05.11.2008) 说明书表格 1 的化合物 I-7、I-19、I-59、I-88, 第 35-37、40 页, 权利要求 1-5	1-9, 13-16												
Y	说明书第 34-35 页	10-12												
<p><input checked="" type="checkbox"/> 其余文件在 C 栏的续页中列出。</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 见同族专利附件。</p>														
<p>*引用文件的具体类型:</p> <p>“A” 认为不特别相关的表示了现有技术一般状态的文件</p> <p>“E” 在国际申请日的当天或之后公布的在先申请或专利</p> <p>“L” 可能对优先权要求构成怀疑的文件, 或为确定另一篇引用文件的公布日而引用的或者因其他特殊理由而引用的文件(如具体说明的)</p> <p>“O” 涉及口头公开、使用、展览或其他方式公开的文件</p> <p>“P” 公布日先于国际申请日但迟于所要求的优先权日的文件</p> <p>“T” 在申请日或优先权日之后公布, 与申请不相抵触, 但为了理解发明之理论或原理的在后文件</p> <p>“X” 特别相关的文件, 单独考虑该文件, 认定要求保护的发明不是新颖的或不具有创造性</p> <p>“Y” 特别相关的文件, 当该文件与另一篇或者多篇该类文件结合并且这种结合对于本领域技术人员为显而易见时, 要求保护的发明不具有创造性</p> <p>“&” 同族专利的文件</p>														
<p>国际检索实际完成的日期</p> <p>29.5 月 2011 (29.05.2011)</p>		<p>国际检索报告邮寄日期</p> <p>18.8 月 2011 (18.08.2011)</p>												
<p>ISA/CN 的名称和邮寄地址:</p> <p>中华人民共和国国家知识产权局</p> <p>中国北京市海淀区蓟门桥西土城路 6 号 100088</p> <p>传真号: (86-10)62019451</p>		<p>受权官员</p> <p>田丁丁</p> <p>电话号码: (86-10)62086303</p>												

C(续). 相关文件		
类 型	引用文件, 必要时, 指明相关段落	相关的权利要求
Y	W02005118552A2 (E. I. DUPONT DE NEMOURS AND COMPANY), 15.12月2005 (15.12.2005), 说明书的方案 11、12、3、1	10—12
A	W02004046129A2 (E. I. DUPONT DE NEMOURS AND COMPANY), 03.6月2004 (03.06.2004), 说明书全文	1—16

国际检索报告
关于同族专利的信息

国际申请号
PCT/CN2011/073810

检索报告中引用的 专利文件	公布日期	同族专利	公布日期
CN101298435A	05.11.2008	WO2008134970A	13.11.2008
WO2005118552A2	15.12.2005	KR20060135881A	29.12.2006
		BR200509413A	04.09.2007
		TW200604180A	01.02.2006
		EP1751112A2	14.02.2007
		JP2007532661T	15.11.2007
		US2007184018A1	09.08.2007
		CN1972915A	30.05.2007
		AU2005250328A1	15.12.2005
		MX2006011776A1	01.01.2007
		WO2005118552A3	26.01.2006
		IN200604977P1	17.08.2007
CN101967139A	09.02.2011	无	
WO2004046129A2	03.06.2004	US7666882B2	23.02.2010
		US2006014808A1	19.01.2006
		IN200501374P1	24.12.2010
		BR0315714A	06.09.2005
		MX263285B	17.12.2008
		EP1560820B1	26.05.2010
		JP4648705B2	09.03.2011
		CN100486975C	13.05.2009
		EP1560820A2	10.08.2005
		JP2006514632T	11.05.2006
		AU2003295491B2	08.10.2009
		AU200329549 A1	15.06.2004
		KR20050075001A	19.07.2005
		DE60332753D1	08.07.2010
		CN1711255A	21.12.2005
WO2004046129A3	15.07.2004		

主题的分类:

C07D401/04 (2006.01) i

C07D401/14 (2006.01) i

C07D413/14 (2006.01) i

C07D231/22 (2006.01) i

C07D413/12 (2006.01) i

A01N43/56 (2006.01) i

A01P7/04 (2006.01) i

A01P7/02 (2006.01) i