

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

A01N 43/36



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 01815123. X

/(A01N43/36,63 : 00,
47 : 38,47 : 34,
47 : 02,43 : 90,
43 : 68,43 : 28,
43 : 24,43 : 16,
37 : 40,37 : 28)

[43] 公开日 2003 年 10 月 29 日

[11] 公开号 CN 1452457A

[22] 申请日 2001.8.23 [21] 申请号 01815123. X
[30] 优先权
[32] 2000. 9. 5 [33] DE [31] 10043610.2
[86] 国际申请 PCT/EP01/09731 2001.8.23
[87] 国际公布 WO02/19824 德 2002.3.14
[85] 进入国家阶段日期 2003.3.4
[71] 申请人 拜尔农作物科学股份公司
地址 德国蒙海姆
[72] 发明人 R·菲舍 C·埃尔德伦

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司
代理人 谭明胜 马崇德

权利要求书 7 页 说明书 27 页

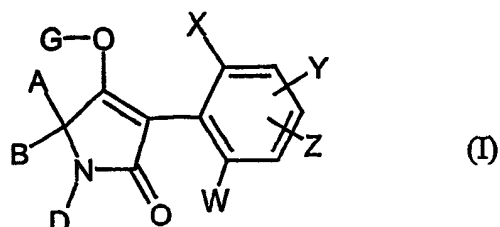
[54] 发明名称 具有杀虫和杀螨性能的活性化合物
组合物

[57] 摘要

本发明涉及含特定的环酮烯醇类化合物和说明书中例举的活性物质(1) - (22) 构成的新的活性物质组合物, 该组合物具有很高的杀虫和杀螨活性。

I S S N 1 0 0 8 - 4 2 7 4

1. 一种组合物, 它包含式(I)化合物和后面列出的化合物系列中的至少一种化合物的混合物,



5

其中

X 表示卤素、烷基、烷氧基、卤代烷基、卤代烷氧基或氰基,

W、Y 和 Z 各自独立表示氢、卤素、烷基、烷氧基、卤代烷基、卤代烷氧基或氰基,

10 A 表示氢、各自任选被卤素取代的烷基、烷氧基烷基、任选取代的饱和环烷基, 其中任选至少一个环原子被杂原子替代,

B 表示氢或烷基,

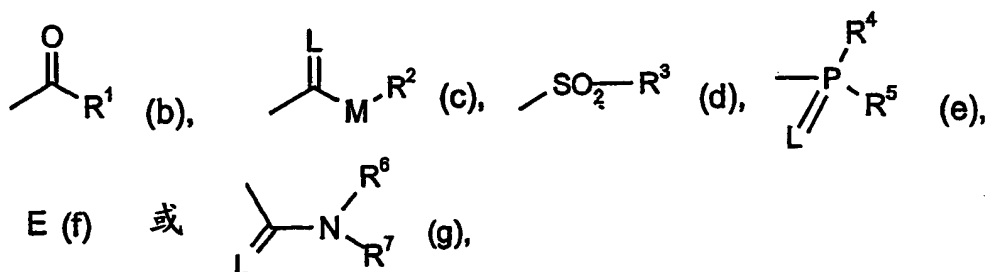
A 和 B 与和其相连的碳原子一起表示饱和的或不饱和的, 任选包含至少一个杂原子的未取代或取代的环,

15 D 表示氢或者任选取代的选自下列的基团: 烷基、链烯基、烷氧基烷基、饱和的环烷基, 其中任选一个或多个环单元被杂原子替代,

A 和 D 和与其相连的原子一起表示饱和的或不饱和的并任选包含至少一个杂原子、在 A, D-部分未取代或取代的环,

G 表示氢(a)或表示下列基团之一

20



其中

E 表示金属离子或铵离子,

L 表示氧或硫,

M 表示氧或硫,

5 R^1 表示各自任选被卤素取代的烷基、链烯基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、多烷氧基烷基或任选被卤素、烷基或烷氧基取代的环烷基, 其可被至少一个杂原子间隔、各自任选取代的苯基、苯基烷基、杂芳基、苯氧基烷基或杂芳基氧基烷基,

R^2 表示各自任选被卤素取代的烷基、链烯基、烷氧基烷基、多烷氧基烷基或表示各自任选取代的环烷基、苯基或苄基,

10 R^3 表示任选被卤素取代的烷基或任选取代的苯基,

R^4 和 R^5 各自独立表示各自任选被卤素取代的烷基、烷氧基、烷基氨基、二烷基氨基、烷硫基、链烯基硫基、环烷基硫基或表示各自任选取代的苯基、苄基、苯氧基或苯硫基, 及

15 R^6 和 R^7 各自独立表示氢、各自任选被卤素取代的烷基、环烷基、链烯基, 烷氧基、烷氧基烷基, 表示任选取代的苯基, 表示任选取代的苄基或与其相连的 N 原子一起表示任选被氧或硫间隔的任选取代的环,

上述化合物系列包含下列化合物:

20 定虫隆
氟脲杀
氟丙氧脲
伏虫隆
杀虫隆
双苯氟脲
25 氟虫脲
氟铃脲
Emamectin
甲氧苯酰肼
双苯酰肼
30 特丁苯酰肼
硫丹
赤眼蜂属

麦柯特尔

锐劲特

灭蝇胺

艾扎丁

5 噁茂醚

噁二唑虫

Chromafenozid

Bistrifluoron.

2. 权利要求 1 的组合物, 包含式 (I) 的化合物, 其中

10 W 表示氢、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、氟、溴或氯,

X 表示 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基、氟、氯或溴,

Y 和 Z 相互独立表示氢、 C_1-C_4 -烷基、卤素、 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -卤代烷基,

A 表示氢或各自任选被卤素取代的 C_1-C_6 -烷基或 C_3-C_8 -环烷基,

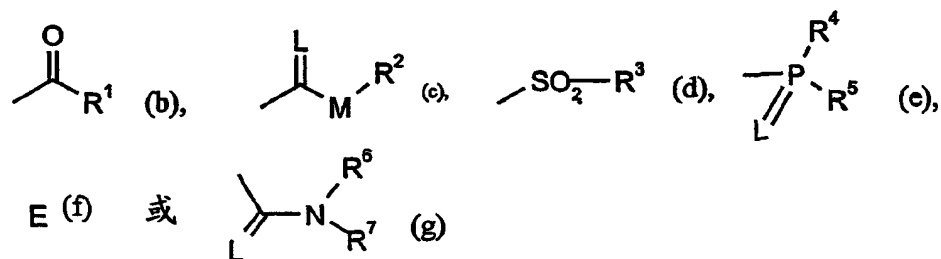
15 B 表示氢, 甲基或乙基,

A、B 和与其相连的碳原子表示饱和的 C_3-C_6 -环烷基, 其中任选一个环单元被氧或硫替代并且其任选被 C_1-C_4 -烷基、三氟甲基或 C_1-C_4 -烷氧基单取代或二取代,

20 D 表示氢、各自任选被氟或氯取代的 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_4 -链烯基或 C_3-C_6 -环烷基,

A 和 D 一起表示各自任选被甲基取代的 C_3-C_4 -烷二基, 其中任选一个亚甲基被硫替代。

G 表示氢 (a) 或表示下列基团之一



25

其中

E 表示金属离子或铵离子,

L 表示氧或硫, 及

M 表示氧或硫,

R^1 表示各自任选被卤素取代的 C_1-C_{10} -烷基、 C_2-C_{10} -链烯基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷硫基- C_1-C_4 -烷基或任选被氟、氯、 C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_2 -烷氧基取代的 C_3-C_6 -环烷基,

表示任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、三氟甲基或三氟甲氧基取代的苯基,

表示各自任选被氟或甲基取代的吡啶基或噻吩基,

R^2 表示各自任选被氟或氯取代的 C_1-C_{10} -烷基、 C_2-C_{10} -链烯基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_2-C_4 -烷基,

表示任选被甲基或甲氧基取代的 C_5-C_6 -环烷基, 或

表示各自任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、三氟甲基或三氟甲氧基取代的苯基或苄基,

R^3 表示任选被氟取代的 C_1-C_4 -烷基或表示任选被氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或硝基取代的苯基,

R^4 表示各自任选被氟或氯取代的 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷基氨基、 C_1-C_4 -烷硫基或表示各自任选被氟、氯、溴、硝基、氰基、 C_1-C_4 -烷氧基、三氟甲氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -卤代烷硫基、 C_1-C_4 -烷基或三氟甲基取代的苯基、苯氧基或苯硫基,

R^5 表示 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -硫代烷基,

R^6 表示 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_3-C_6 -链烯基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基,

R^7 表示 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_6 -链烯基或 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基,

R^6 和 R^7 一起表示任选被甲基或乙基取代的 C_3-C_6 -亚烷基, 其中任选一个碳原子被氧或硫替代。

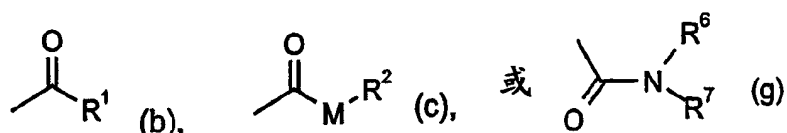
3. 权利要求 1 的组合物, 包含式 (I) 的化合物, 其中

W 表示氢、甲基、乙基、氯、溴或甲氧基,

X 表示氯、溴、甲基、乙基、丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基或三氟甲基,

Y 和 Z 各自独立表示氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、丙基、异丙基、三氟甲基或甲氧基,

- A 表示甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、环丙基、环戊基或环己基，
 B 表示氢、甲基或乙基，
 A、B 与和其相连的碳原子表示饱和的 C_6 -环烷基，其中任选一个环单元
 5 被氧替代并且其任选被甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、丙氧基或丁氧基单取代，
 D 表示氢，表示甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、烯丙基、环丙基、环戊基或环己基，
 A 和 D 一起表示任选被甲基取代的 C_3 - C_4 -烷二基，
 10 G 表示氢 (a) 或下列基团之一



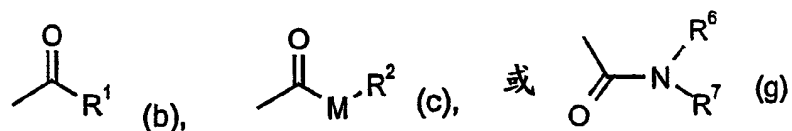
- 其中
 M 表示氧或硫，
 15 R^1 表示 C_1 - C_8 -烷基、 C_2 - C_4 -链烯基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、乙硫基甲基、环丙基、环戊基或环己基，
 表示任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、甲基、乙基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基取代的苯基，
 表示各自任选被氯或甲基取代的吡啶基或噻吩基，
 20 R^2 表示 C_1 - C_8 -烷基、 C_2 - C_4 -链烯基、甲氧基乙基、乙氧基乙基或表示苯基或苄基，
 R^6 和 R^7 各自独立特别优选表示甲基或乙基或一起表示 C_5 -亚烷基，其中 C_3 -亚甲基被氧替代。

4. 权利要求 1 的组合物，包含式 (I) 的化合物，其中
 25 W 表示氢或甲基，
 X 表示氯、溴或甲基，
 Y 和 Z 各自独立表示氢、氯、溴或甲基，
 A、B 与和其相连的碳原子表示饱和的 C_6 -环烷基，其中任选一个环单元被氧替代并且其任选被甲基、甲氧基、乙氧基、丙氧基或丁氧基

单取代,

D 表示氢,

G 表示氢 (a) 或表示下列基团之一



5

其中

M 表示氧或硫,

R^1 表示 $\text{C}_1\text{-C}_8$ -烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ -链烯基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、乙基甲
硫基、环丙基、环戊基、环己基, 或

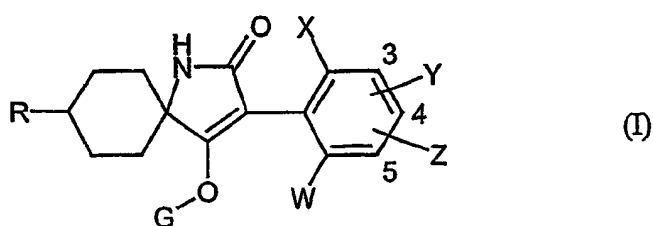
10 表示任选被氟、氯、溴、甲基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、
氟基或硝基取代的苯基,

表示各自任选被氯或甲基取代的吡啶基或噻吩基,

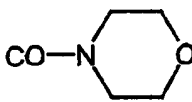
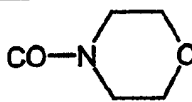
R^2 表示 $\text{C}_1\text{-C}_8$ -烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ -链烯基、甲氧基乙基、乙氧基乙基、苯基或
苄基,

15 R^6 和 R^7 各自独立表示甲基、乙基或一起表示 C_5 -亚烷基, 其中 C_3 -亚甲
基被氧替代。

5. 权利要求 1 的组合物, 包含式 (I) 的化合物



20 其中 W、X、Y、Z、R 和 G 各具有下表中给出的定义:

W	X	Y	Z	R	G
H	Br	5-CH ₃	H	OCH ₃	CO-i-C ₃ H ₇
H	Br	5-CH ₃	H	OCH ₃	CO ₂ -C ₂ H ₅
H	CH ₃	5-CH ₃	H	OCH ₃	H
H	CH ₃	5-CH ₃	H	OCH ₃	CO ₂ -C ₂ H ₅
CH ₃	CH ₃	3-Br	H	OCH ₃	H
CH ₃	CH ₃	3-Cl	H	OCH ₃	H
H	Br	4-CH ₃	5-CH ₃	OCH ₃	CO-i-C ₃ H ₇
H	CH ₃	4-Cl	5-CH ₃	OCH ₃	CO ₂ -C ₂ H ₅
H	CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃	OCH ₃	
CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	4-CH ₃	OCH ₃	H
H	CH ₃	5-CH ₃	H	OC ₂ H ₅	
CH ₃	CH ₃	3-Br	H	OC ₂ H ₅	CO-i-C ₃ H ₇
H	CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃	OC ₂ H ₅	CO-n-Pr
H	CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃	OC ₂ H ₅	CO-i-Pr
H	CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃	OC ₂ H ₅	CO-c-Pr

6. 权利要求 1、2、3、4 和 5 定义的混合物用于防治有害动物的用途。

7. 防治有害动物的方法, 其特征在于将权利要求 1、2、3、4 和 5 定义的混合物作用于有害动物和/或它们的栖息地。

8. 杀虫和杀螨组合物的制备方法, 其特征在于将权利要求 1、2、3、4 和 5 定义的混合物与填充剂和/或表面活性剂混合。

具有杀虫和杀螨性能的活性化合物组合物

本发明涉及新的活性化合物组合物,其一方面含有已知的环酮烯醇
5 以及另一方面含有其它的已知杀虫活性化合物,该组合物特别适于防治有害动物如昆虫和害螨。

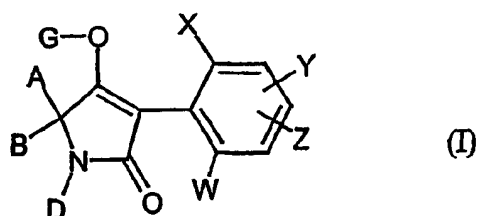
已知某些环酮烯醇具有除草、杀虫和杀螨性能。虽然这些化合物具有很好的活性,但在低施用量条件下往往效果不令人满意。

已知具有除草、杀虫或杀螨作用的是未取代的、双环 3-芳基-吡咯
10 烷-2,4-二酮-衍生物 (EP-A-355 599 和 EP-A-415 211) 以及取代的单环 3-芳基-吡咯烷-2,4-二酮-衍生物 (EP-A-377 893 和 EP-A-442 077)。

此外已知多环的 3-芳基吡咯烷-2,4-二酮-衍生物 (EP-A-442 073) 以及 1H-芳基吡咯烷-二酮-衍生物 (EP-A-456 063、EP-A-521 334、
15 EP-A-596 298、EP-A-613 884、EP-A-613 885、WO 94/01 997、WO 95/26 954、WO 95/20 572、EP-A-0 668 267、WO 96/25 395、WO 96/35 664、WO 97/01 535、WO 97/02 243、WO 97/36 868、WO 97/43 275、WO 98/05 638、WO 98/06 721、WO 98/25 928、WO 99/16 748、WO 99/24 437、WO 99/43 649、WO 99/48 869 和 WO 99/55 673)。

另外,已知大量磷酸酯类、氨基甲酸酯类、杂环类、有机锡类化合物、
20 苯甲酰脲和拟除虫菊酯化合物具有杀虫和杀螨活性 (参见 US 2,758,115、US 3,309,266、EP-A-004 334、GB-A-1181657、WO 93/22 297、WO 93/10 083、DE-A-2 641 343、EP-A-347 488、EP-A-210 487、US 3,264,177 和 EP-A-234 045)。然而,上述物质的活性也不总是令人满意。

25 已发现,式(I)化合物



其中

X 表示卤素, 烷基、烷氧基、卤代烷基、卤代烷氧基或氰基,

W、Y 和 Z 各自独立表示氢、卤素、烷基、烷氧基、卤代烷基、卤代烷氧基或氰基,

- 5 A 表示氢、各自任选被卤素取代的烷基、烷氧基烷基、任选取代的饱和环烷基, 其中任选至少一个环原子被杂原子替代,

B 表示氢或烷基,

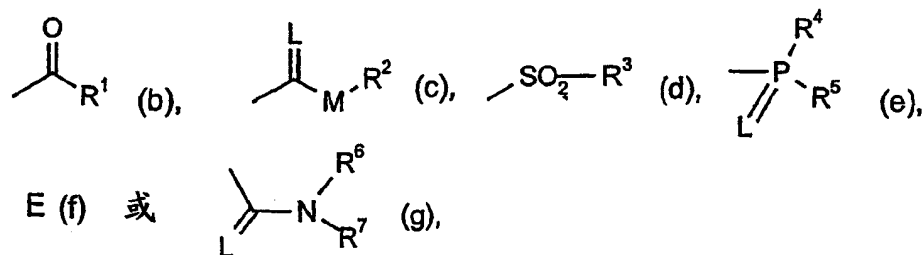
A 和 B 与和其相连的碳原子一起表示饱和的或不饱和的、未取代或取代的任选至少包含一个杂原子的环,

- 10 D 表示氢或者任选取代的选自下列的基团: 烷基、链烯基、烷氧基烷基、饱和的环烷基, 其中任选一个或多个环单元被杂原子替代,

A 和 D 和与其相连的原子一起表示饱和的或不饱和的并任选至少包含一个杂原子、在 A, D-部分未取代或取代的环,

G 表示氢 (a) 或表示下列基团之一

15



其中

E 表示金属离子或铵离子,

L 表示氧或硫,

- 20 M 表示氧或硫,

R¹ 表示各自任选被卤素取代的烷基、链烯基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、多烷氧基烷基或任选被卤素、烷基或烷氧基取代的环烷基, 其可被至少一个杂原子间隔, 各自任选取代的苯基、苯基烷基、杂芳基 (Hetaryl)、苯氧基烷基或杂芳基氧基烷基,

- 25 R² 表示各自任选被卤素取代的烷基、链烯基、烷氧基烷基、多烷氧基烷基或表示各自任选取代的环烷基、苯基或苄基,

R³ 表示任选被卤素取代的烷基或任选取代的苯基,

R^4 和 R^5 各自独立表示各自任选被卤素取代的烷基、烷氧基、烷基氨基、二烷基氨基、烷硫基、链烯基硫基、环烷基硫基或表示各自任选取代的苯基、苄基、苯氧基或苯硫基，及

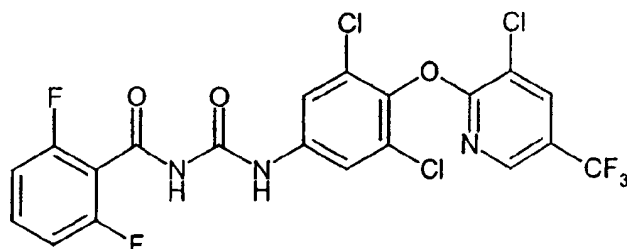
5 R^6 和 R^7 各自独立表示氢、各自任选被卤素取代的烷基、环烷基、链烯基，烷氧基、烷氧基烷基，表示任选取代的苯基，表示任选取代的苄基或与其相连的 N 原子一起表示任选被氧或硫间隔的任选取代的环

和

A) 苯甲酰基脲类化合物，优选

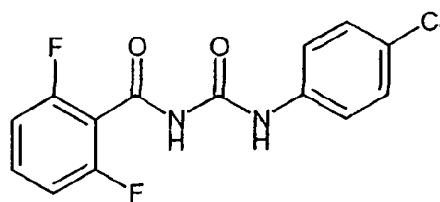
10

1. 公开在 DE-A-2 818 830 中的定虫隆



和/或

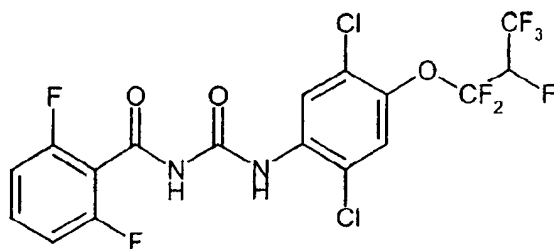
15 2. 公开在 DE-A 2 123 236 中的氟脲杀



和/或

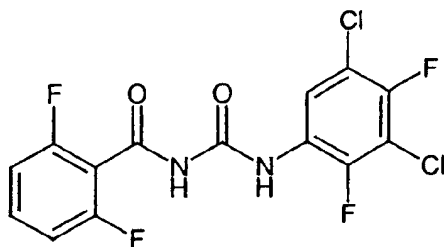
3. 公开在 EP-A-179 022 中的氟丙氧脲

20



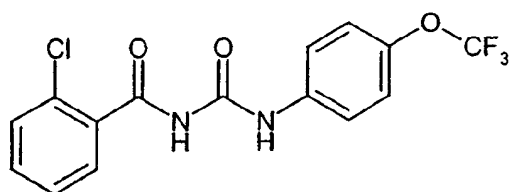
和/或

4. 公开在 EP-A-052 833 中的伏虫隆



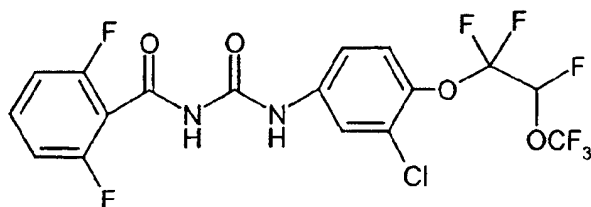
5 和/或

5. 公开在 DE-A-2 601 780 中的杀虫隆

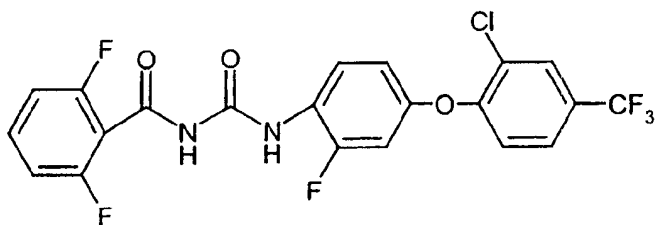


和/或

10 6. 公开在 US 4,980,376 中的双苯氟脬

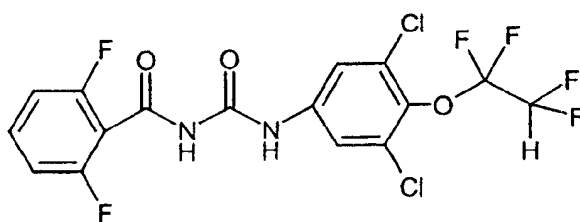


7. 公开在 EP-A 161 019 中的氟虫脬



15

8. 公开在 EP-A 71 279 中的氟铃脬



B) 大环内酯, 优选

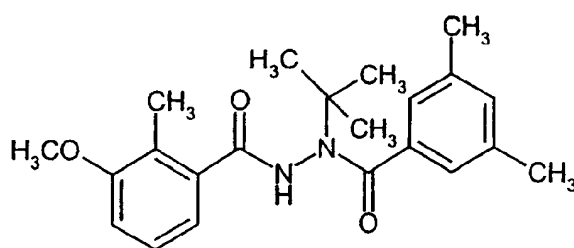
9. 公开在 EP-A-089 202 中的 Emamectin

5

和/或

C) 二酰基胍类化合物, 优选

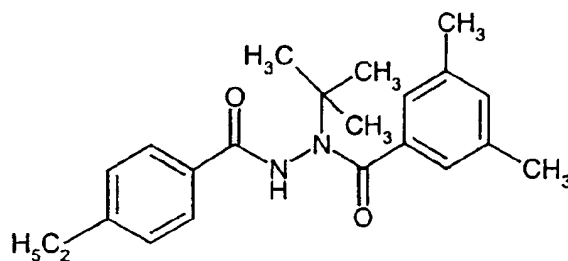
10. 公开在 EP-A-639 559 中的甲氧苯酰胍



和/或

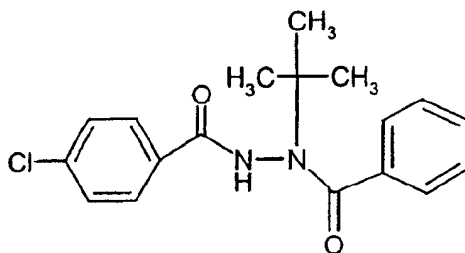
11. 公开在 EP-A-339 854 中的双苯酰胍

15



和/或

12. 公开在 EP-A 228 564 中的特丁苯酰胍

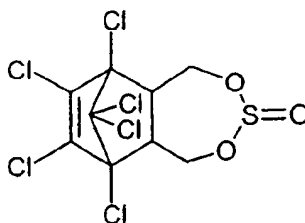


和/或

D) 卤代环烷烃, 优选

5

13. 公开在 DE-A-1 015 797 中的硫丹



和/或

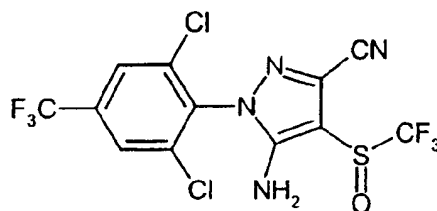
10 14. 公开在 The Pesticide Manual, 第 11 版, 1997, 第 1236 页中的赤眼蜂属 (*Trichogramma* spp.)

和/或

15. 公开在 The Pesticide Manual, 第 11 版, 1997, 第 1266 页中的麦柯特尔

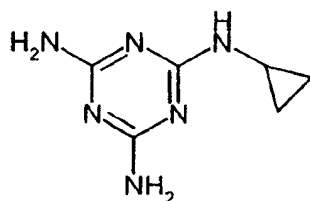
15 和/或

16. 公开在 EP-A-295 117 中的锐劲特



20 和/或

17. 公开在 DE-A-2 736 876 中的灭蝇胺

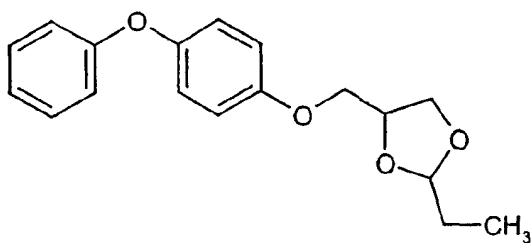


和/或

18. 公开在 The Pesticide Manual, 第 11 版, 1997, 第 59 页中的艾扎丁

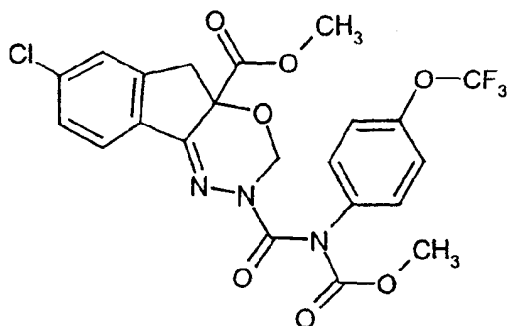
5 和/或

19. 公开在 DE-A 2 655 910 中的噁茂醚



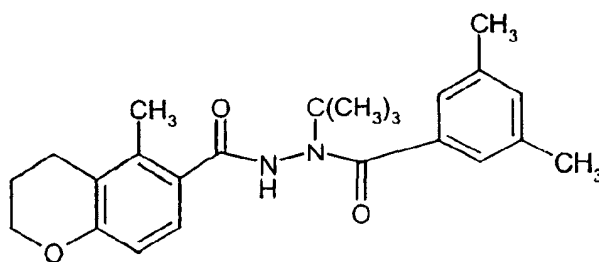
和/或

10 20. 公开在 WO 92/11249 中的噁二唑虫



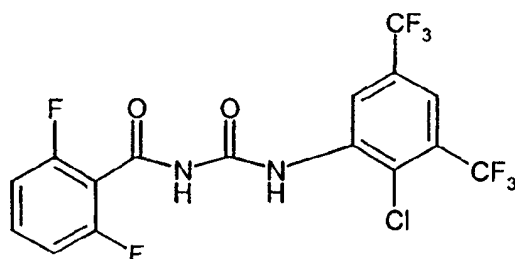
和/或

21. 公开于 EP-A-496 342 中的 Chromafenozid (ANS-118)



和/或

22. 公开于 WO 98/00 394 中的 Bistrifluoron (DBI-3204)



5

具有很好的杀虫和杀螨活性。

令人惊奇的是,本发明活性化合物组合物的杀虫和杀螨活性显著高于各个活性化合物的活性总和。即存在事先没有预料到的实际的增效活性,而不仅仅是作用加和。

10 本发明活性化合物组合物中,除了至少一种式(I)活性化合物外,还包括化合物 1-22 中的至少一种活性化合物。

优选包括下列式(I)化合物的活性化合物组合物,其中的基团具有下述含义:

W 优选表示氢、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、氯、溴或氟,

15 X 优选表示 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 卤代烷基、氯、溴或氟,

Y 和 Z 各自独立优选表示氢、 C_{1-4} 烷基、卤素、 C_{1-4} 烷氧基或 C_{1-4} 卤代烷基,

A 优选表示氢或各自任选被卤素取代的 C_{1-6} 烷基或 C_{3-8} 环烷基,

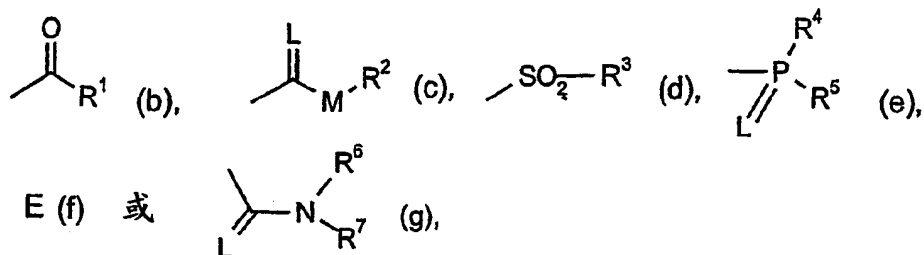
B 优选表示氢、甲基或乙基,

20 A 和 B 与和其相连的碳原子一起优选表示饱和的 C_{3-6} 环烷基,其中任选一个环单元被氧或硫代替并且其任选被 C_{1-4} 烷基、三氟甲基或 C_{1-4} 烷氧基一或二取代,

D 优选表示氢、各自任选被氟或氯取代的 C_{1-6} 烷基、 C_{3-4} 链烯基或 C_{3-6} 环烷基，

A 和 D 一起优选表示任选被甲基取代的 C_{3-4} 链烷二基，其中任选一个亚甲基被硫代替。

5 G 优选表示氢 (a) 或表示下列基团之一



，尤其表示 (a)、(b)、(c) 或 (g)

其中

10 E 表示金属离子或铵离子，

L 表示氧或硫，

M 表示氧或硫，

15 R^1 优选表示各自任选被卤素取代的 C_1-C_{10} -烷基、 C_2-C_{10} -链烯基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷硫基- C_1-C_4 -烷基或任选被氟、氯、 C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_2 -烷氧基取代的 C_3-C_6 -环烷基，

表示任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、三氟甲基或三氟甲氧基取代的苯基，

表示各自任选被氯或甲基取代的吡啶基或噻吩基，

20 R^2 优选表示各自任选被氟或氯取代的 C_1-C_{10} -烷基、 C_2-C_{10} -链烯基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_2-C_4 -烷基，

表示任选被甲基或甲氧基取代的 C_5-C_6 -环烷基或

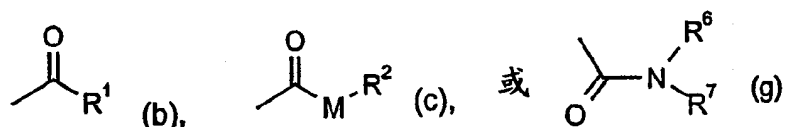
表示各自任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、三氟甲基或三氟甲氧基取代的苯基或苄基，

25 R^3 优选表示任选被氟取代的 C_1-C_4 -烷基或表示任选被氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或硝基取代的苯基，

R^4 优选表示各自任选被氟或氯取代的 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -

- 烷基氨基、 C_1-C_4 -烷硫基或表示各自任选被氟、氯、溴、硝基、氰基、 C_1-C_4 -烷氧基、三氟甲氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -卤代烷硫基、 C_1-C_4 -烷基或三氟甲基取代的苯基、苯氧基或苯硫基，
- R^5 优选表示 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -硫代烷基，
- 5 R^6 优选表示 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_3-C_6 -链烯基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基，
- R^7 优选表示 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_6 -链烯基或 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基，
- R^6 和 R^7 一起优选表示任选被甲基或乙基取代的 C_3-C_6 -亚烷基，其中任选一个碳原子被氧或硫替代，
- 10 W 特别优选表示氢、甲基、乙基、氯、溴或甲氧基，
- X 特别优选表示氯、溴、甲基、乙基、丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基或三氟甲基，
- Y 和 Z 各自独立特别优选表示氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、丙基、异丙基、三氟甲基或甲氧基，
- 15 A 特别优选表示甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、环丙基、环戊基或环己基，
- B 特别优选表示氢、甲基或乙基，
- A、B 与和其相连的碳原子特别优选表示饱和的 C_6 -环烷基，其中任选一个环单元被氧替代并且其任选被甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、丙氧基或丁氧基单取代，
- 20 D 特别优选表示氢，表示甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、烯丙基、环丙基、环戊基或环己基，
- A 和 D 一起特别优选表示任选被甲基取代的 C_3-C_4 -烷二基，
- G 特别优选表示氢 (a) 或下列基团之一

25

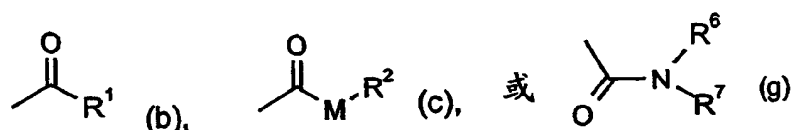


其中

M 表示氧或硫，

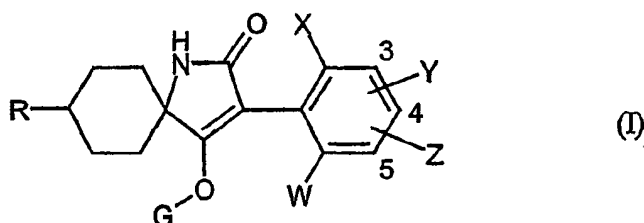
 R^1 特别优选表示 C_1-C_8 -烷基、 C_2-C_4 -链烯基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、

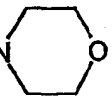
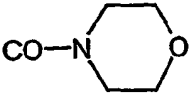
- 乙硫基甲基、环丙基、环戊基或环己基，
表示任选被氟、氯、溴、氰基、硝基、甲基、乙基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基取代的苯基，
表示各自任选被氯或甲基取代的吡啶基或噻吩基，
- 5 R^2 特别优选表示 C_1-C_8 -烷基、 C_2-C_4 -链烯基、甲氧基乙基、乙氧基乙基或表示苯基或苄基，
 R^6 和 R^7 各自独立特别优选表示甲基、乙基或一起表示 C_5 -亚烷基，其中 C_3 -亚甲基被氧替代。
- W 非常特别优选表示氢或甲基，
- 10 X 非常特别优选表示氯、溴或甲基，
Y 和 Z 各自独立非常特别优选表示氢、氯、溴或甲基，
A、B 与和其相连的碳原子非常特别优选表示饱和的 C_6 -环烷基，其中任选一个环单元被氧替代并且其任选被甲基、甲氧基、乙氧基、丙氧基或丁氧基单取代，
- 15 D 非常特别优选表示氢，
G 非常特别优选表示氢 (a) 或表示下列基团之一



- 其中
- 20 M 表示氧或硫，
 R^1 非常特别优选表示 C_1-C_8 -烷基、 C_2-C_4 -链烯基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、乙基甲硫基、环丙基、环戊基、环己基，或
表示任选被氟、氯、溴、甲基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或硝基取代的苯基，
- 25 表示各自任选被氯或甲基取代的吡啶基或噻吩基，
 R^2 非常特别优选表示 C_1-C_8 -烷基、 C_2-C_4 -链烯基、甲氧基乙基、乙氧基乙基、苯基或苄基，
 R^6 和 R^7 各自独立非常特别优选表示甲基、乙基或一起表示 C_5 -亚烷基，其中 C_3 -亚甲基被氧替代。

尤其优选含有下列式(I)化合物



实施例号	W	X	Y	Z	R	G	Fp. °C
I-1	H	Br	5-CH ₃	H	OCH ₃	CO-i-C ₃ H ₇	122
I-2	H	Br	5-CH ₃	H	OCH ₃	CO ₂ -C ₂ H ₅	140 - 142
I-3	H	CH ₃	5-CH ₃	H	OCH ₃	H	> 220
I-4	H	CH ₃	5-CH ₃	H	OCH ₃	CO ₂ -C ₂ H ₅	128
I-5	CH ₃	CH ₃	3-Br	H	OCH ₃	H	> 220
I-6	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H	OCH ₃	H	219
I-7	H	Br	4-CH ₃	5-CH ₃	OCH ₃	CO-i-C ₃ H ₇	217
I-8	H	CH ₃	4-Cl	5-CH ₃	OCH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	162
I-9	H	CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃	OCH ₃	CO-N 	油状物
I-10	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	4-CH ₃	OCH ₃	H	>220
I-11	H	CH ₃	5-CH ₃	H	OC ₂ H ₅	CO-N 	油状物
I-12	CH ₃	CH ₃	3-Br	H	OC ₂ H ₅	CO-i-C ₃ H ₇	212 - 214
I-13	H	CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃	OC ₂ H ₅	CO-n-Pr	134
I-14	H	CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃	OC ₂ H ₅	CO-i-Pr	108
I-15	H	CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃	OC ₂ H ₅	CO-c-Pr	163

和至少一种活性化合物 1-22 的组合物。

5 此外, 活性化合物组合物中还可以含有其它杀菌、杀螨或杀虫活性成分。

当本发明活性化合物组合物中的活性化合物以特定重量比存在时, 增效作用特别明显。然而, 在本发明活性化合物组合物中活性化合物重量比可在很宽的范围内变化。通常, 本发明组合物包含下表中所给出的
10 优选或特别优选的混合比的式(I)活性化合物与共混组分

(Mischpartner):

* 混合比以重量比计。混合比表示式(I)活性化合物: 共混组分

共混组分	优选的混合比	特别优选的混合比
定虫隆	10:1 至 1:10	5:1 至 1:5
氟脲杀	10:1 至 1:10	5:1 至 1:5
氟丙氧脲	20:1 至 1:5	10:1 至 1:2
伏虫隆	20:1 至 1:5	10:1 至 1:2
杀虫隆	10:1 至 1:10	5:1 至 1:5
双苯氟脲	10:1 至 1:10	5:1 至 1:5
氟虫脲	10:1 至 1:10	5:1 至 1:5
氟铃脲	20:1 至 1:5	5:1 至 1:2
Emamectin	50:1 至 1:5	10:1 至 1:1
甲氧苯酰肼	10:1 至 1:10	5:1 至 1:5
双苯酰肼	10:1 至 1:10	5:1 至 1:5
特丁苯酰肼	2:1 至 1:100	1:1 至 1:30
硫丹	10:1 至 1:10	5:1 至 1:5
锐劲特	10:1 至 1:10	5:1 至 1:5
灭蝇胺	10:1 至 1:10	5:1 至 1:5
艾扎丁	50:1 至 1:5	10:1 至 1:1
噁茂醚	100:1 至 1:2	20:1 至 1:1
噁二唑虫	50:1 至 1:5	20:1 至 1:2
Chromafenozid	10:1 至 1:10	5:1 至 1:5
Bistrifluoron	10:1 至 1:10	5:1 至 1:5
赤眼蜂属	1000g a. i. /ha: 20000wasps/ha 至 10g a. i. /ha: 500000wasps/ha	300g a.i./ha:50000wasps/ha 至 50g a. i. /ha: 300000wasps/ha
麦柯特尔	0.05% a. i.: 0.05% F ^(*) 至 0.001% a. i.: 0.5% F ^(*)	0.03% a. i.: 0.1% F ^(*) 至 0.005% a. i.: 0.2% F ^(*)

F^(*) 含有 10⁹ - 10¹⁰ 个孢子/g 的组合物 (Formulierung)

本发明活性化合物组合物适合防治有害动物, 优选节肢动物和线虫, 特别是在农业、林业中的动物保护、储藏产品和材料的保护以及卫生领域中发生的昆虫和螨类。它们对普通敏感和抗性种类以及对所有或单个发育阶段都具有活性。上述有害动物包括:

- 5 等足目, 例如, 潮虫 (*Oniscus asellus*)、平甲虫、鼠妇。
 倍足目, 例如, 具斑马陆。
 唇足目, 例如, 食果地蜈蚣、蚰蜒属。
 综合目, 例如, 庭园么蚰。
 缨尾目, 例如, 台湾衣鱼。
- 10 弹尾目, 例如, 武装棘跳虫。
 直翅目, 例如, 家蟋蟀、蝼蛄属、非洲飞蝗、黑蝗属、沙漠蝗。
 蜚蠊目, 例如, 东方蜚蠊、美洲大蠊、马得拉蜚蠊、德国小蠊。
 革翅目, 例如, 欧洲球螋。
 等翅目, 例如, 散白蚁属。
- 15 虱目, 例如, 体虱、血虱属、颚虱属、嚼虱属、畜虱属。
 缨翅目, 例如, 温室条蓟马、烟蓟马、棕榈蓟马、苜蓿蓟马。
 异翅亚目, 例如, 扁盾蝽属、棉红蝽 (*Dysdercus intermedius*)、方背皮蝽、温带臭虫、长红猎蝽、椎猎蝽属。
- 同翅目, 例如, 甘蓝粉虱、甘薯粉虱、温室白粉虱、棉蚜、甘蓝蚜、
20 茶藨隐瘤蚜、豆卫矛蚜、苹果蚜、苹果绵蚜、桃大尾蚜、葡萄根瘤蚜、
 瘿绵蚜属、麦长管蚜、瘤蚜属、忽布疣蚜、禾谷缢管蚜、绿小叶蝉属、
 秧叶蝉 (*Euscelis bilobatus*)、黑尾叶蝉、欧果坚球蚧、榄珠蜡蚧、
 灰飞虱、褐飞虱、红肾圆盾蚧、常春藤圆盾蚧、粉蚧属、木虱属。
- 鳞翅目, 例如, 棉红铃虫、松粉蝶尺蛾、果园秋尺蛾、潜叶细蛾
25 (*lithocolletis blancardella*)、苹果巢蛾、小菜蛾、黄褐天幕毛虫、
 黄毒蛾、毒蛾属、棉潜蛾 (*Bucculatrix thurberiella*)、柑橘潜叶蛾、
 地夜蛾属、切夜蛾属、脏切夜蛾、埃及钻夜蛾、实夜蛾属、甘蓝夜蛾、
 小眼夜蛾、灰翅夜蛾属、粉纹夜蛾、苹果蠹蛾、粉蝶属、禾草螟属、玉
 米螟、地中海粉斑螟、蜡螟、幕谷蛾、袋谷蛾、褐织蛾、黄尾卷叶蛾、
30 烟卷蛾 (*Capua reticulana*)、云杉色卷蛾、葡萄果蠹蛾、茶长卷蛾、
 栎绿卷蛾、*Cnaphalocerus* 属、水稻负泥虫。
- 鞘翅目, 例如, 家具窃蠹、谷蠹、豆象 (*Bruchidius obtectus*)、菜

豆象、北美家天牛、蓝毛臀萤叶甲、马铃薯叶甲、辣根猿叶甲、条叶甲属、油菜金头跳甲、墨西哥豆瓢虫、隐食甲属、锯谷盗、花象属、米象属、葡萄黑耳喙象、香蕉根颈象、种子象、紫苜蓿叶象、皮蠹属、斑皮蠹属、圆皮蠹属、毛皮蠹属、粉蠹属、油菜花露尾甲、蛛甲属、黄蛛甲、5 麦蛛甲、拟谷盗属、黄粉甲、叩甲属、宽胸叩甲属、五月鳃金龟、马铃薯鳃金龟、褐新西兰肋翅鳃角金龟、稻水象。

膜翅目,例如,松叶蜂属、实叶蜂属、毛蚁属、小家蚁、胡蜂属。

双翅目,例如,伊蚊属、按蚊属、库蚊属、黄猩猩果蝇、家蝇属、厕蝇属、红头丽蝇、绿蝇属、金蝇属、疽蝇属、胃蝇属、虱蝇属、螫蝇10 属、狂蝇属、皮蝇属、虻属、塘螂属(*Tannia* spp.)、花园毛蚊、瑞典麦杆蝇、草种蝇属、菠菜泉蝇、地中海实蝇、油橄榄果实蝇、沼泽大蚊、种蝇属、斑潜蝇属。

蚤目,例如,印鼠客蚤、角叶蚤属。

蛛形纲,例如,蝎(*Scorpio maurus*)、红斑蛛、粗脚粉螨、锐缘婢15 属、纯缘婢属、鸡皮刺螨、兔瘰螨、柑橘皱叶刺瘰螨、牛婢属、扇头婢属、花婢属、璃眼婢属、硬婢属、瘡螨属、痒螨属、疥螨属、跗线螨属、苜蓿苔螨、全爪螨属、叶螨属、半跗线螨属、短须螨属。

植物寄生线虫包括,例如短体线虫属、相似穿孔线虫、起绒草茎线虫、半穿刺线虫、异皮属、球异皮属、根结属、滑刃线虫属、长针线虫20 属、剑线属、毛刺属、伞滑刃线虫属。

本发明活性化合物组合物可被转化成为常规制剂如溶液剂、乳剂、可湿性粉剂、悬浮剂、粉剂、细粉剂、糊剂、可溶性粉剂、颗粒剂、浓悬浮乳剂、用活性化合物浸渍的天然和合成材料以及聚合物包封的微胶囊剂。

25 这些制剂是以已知方法制备的,例如通过将活性化合物与填充剂,即液体溶剂和/或固体载体混合而生产,制剂中任选使用表面活性剂,即乳化剂和/或分散剂和/或发泡剂。

在使用水作为填充剂的情况下,例如,也可使用有机溶剂作为助溶剂。适合的液体溶剂主要有:芳香烃类,如二甲苯、甲苯或烷基苯;氯30 代芳烃类或氯代脂肪烃类,如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂肪烃类,如环己烷或链烷烃,例如矿物油馏份、矿物油和植物油;醇类,如丁醇或乙二醇及其醚和酯类,酮类,如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环

己酮；强极性溶剂，如二甲基甲酰胺和二甲基亚砷，以及水。

适合的固体载体有：

例如，铵盐和天然矿物粉末，如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、硅镁土、蒙脱土或硅藻土，和合成矿物粉末，如高分散二氧化硅、氧化铝和硅酸盐；适合颗粒剂的固体载体有：例如，粉碎和分级的天然岩石，如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石，以及合成的无机和有机粉末颗粒，以及有机材料的颗粒如锯末、坚果壳、玉米穗茎和烟草茎；适合的乳化剂和/或发泡剂有：例如非离子和阴离子乳化剂，如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚，例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐以及蛋白水解产物；适合的分散剂有：例如木素亚硫酸废液和甲基纤维素。

在制剂中还可使用粘着剂如羧甲基纤维素和粉末、颗粒或胶乳状的天然或合成聚合物，如阿拉伯树胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯，以及天然磷脂如脑磷脂和卵磷脂和合成磷脂。其它添加剂可以是矿物油和植物油。

可以使用的着色剂如无机颜料，例如氧化铁、氧化钛和普鲁士兰，和有机染料，如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料，和痕量营养物如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

制剂中通常含有按重量计0.1-95%，优选0.5-90%的活性化合物。

本发明活性化合物组合物可以其市售通用制剂和从上述制剂制备的应用形式，并与其它活性化合物的混合物的形式存在，其它活性化合物如杀虫剂、引诱剂、消毒剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、植物生长调节剂或除草剂。杀虫剂包括，例如磷酸酯、氨基甲酸酯、羧酸酯、卤代烃类、苯基脲类和从微生物中生产的物质等。

还可与其它已知活性化合物如除草剂或与肥料和植物生长调节剂混合。

当用作杀虫剂时，本发明活性化合物组合物还可以其市售通用制剂和从上述制剂制备的应用形式，并与增效剂混合使用。增效剂是能够增加活性化合物活性，但加入的增效剂本身不必须有活性的化合物。

从市售通用制剂制备的应用形式中活性化合物的含量可在很宽的范围内变化。使用形式中活性化合物的浓度为0.0000001至95重量%的活性化合物，优选0.0001至1重量%。

本发明化合物以适合于以应用形式的常规方式施用。

当用于防治卫生害虫和储藏物品中的害虫时, 活性化合物组合物具有优异的木材和粘土残留活性以及对刷过石灰浆的基底具有很好的碱稳定性。

- 5 本发明活性化合物组合物不仅对植物害虫、卫生害虫和储藏物品中的害虫具有活性, 而且在兽医领域, 对防治动物寄生虫(外寄生虫)也有活性, 例如硬蜱、软蜱、兽疥癣螨、虱状蒲螨、蝇(叮咬和吸食)、寄生性蝇幼虫、虱、毛虱、羽虱和跳蚤。这些寄生虫包括:

虱目, 例如, 血虱属、颚虱属、虱属、*Pthirus* spp.、管虱属;

- 10 食毛目以及钝角亚目和细角亚目, 例如, 毛羽虱属、*Menopon* spp.、巨毛虱属、羽虱属、*Werneckiella* spp.、*Lepikentron* spp.、畜虱属、嚼虱属、猫羽虱属;

- 双翅目以及长角亚目和短角亚目, 例如, 伊蚊属、按蚊属、库蚊属、蚋属、真蚋属、白蛉属、*Lutzomyia* spp.、库蠓属、斑虻属、瘤虻属、15 黄虻属、虻属、麻翅虻属、*Philipomyia* spp.、蜂虱蝇属、家蝇属、齿股蝇属、螫蝇属、角蝇属、莫蝇属、厕蝇属、舌蝇属、丽蝇属、绿蝇属、金蝇属、*Wohlfahrtia* spp.、麻蝇属、狂蝇属、皮蝇属、胃蝇属、虱蝇属、*Lipoptena* spp.、婢蝇属;

蚤目, 例如, 蚤属、栉首蚤属、印鼠客蚤属、角叶蚤属;

- 20 异翅亚目, 例如, 臭虫属、椎猎蝽属、红腹猎蝽属、全圆蝽属;

蜚蠊目, 例如, 东方蜚蠊、美洲大蠊、德国小蠊、蜚蠊属;

- 25 婢螨目以及后气门亚目和中气门亚目, 例如, 锐缘婢属、纯缘婢属、残喙婢属、硬婢属、花婢属、牛婢属、革婢属、*Haemophysalis* spp.、璃眼婢属、扇头婢属、皮刺螨属、刺利螨属、肺刺螨属、胸孔螨属、瓦螨属;

辐螨亚目(前气门亚目)和粉螨目(无气门亚目), 例如, 蜂跗线螨属、姬螯螨属、禽螯厘螨属、肉螨属、疮螨属、蠕形螨属、恙螨属、牦螨属、粉螨属、食酪螨属、嗜木螨属、颈下螨属、翅螨属、瘙螨属、痒螨属、耳螨属、疥螨属、痂螨属、疣螨属、胞螨属、皮膜螨属。

- 30 本发明活性化合物组合物也适用于防治侵扰农业家畜的节肢动物, 所述农业家畜如牛、绵羊、山羊、马、猪、驴、骆驼、水牛、兔、鸡、火鸡、鸭、鹅、蜜蜂, 其它家养动物, 例如狗、猫、笼养鸟、水族馆的

鱼,还有所谓的试验动物,例如田鼠、豚鼠、大鼠和小鼠。通过防治上述节肢动物,旨在减少动物死亡和减产(肉、奶、毛、皮、蛋、蜜等)的情况,因此,通过使用本发明的活性化合物组合物可以使畜牧业管理更经济而简便。

- 5 应用于兽医领域时,本发明活性化合物组合物可通过已知方法即经肠给药,例如以片剂、胶囊剂、饮剂、灌药剂、颗粒剂、膏剂、大丸剂、喂食方法、栓剂等形式给药;非经肠给药,例如通过注射(肌肉注射、皮下注射、静脉注射、腹膜内注射等),植入法给药;经鼻给药;经皮肤给药,例如以浸泡或药浴、喷雾、泼浇、擦、洗刷、撒粉方式给药,也可借助于含有活性化合物的成型制品,例如项圈、耳饰物、尾饰物、肢环(带)、笼头、装饰器具等给药。

当用于家畜、家禽、宠物等时,可将本发明的活性化合物组合物作为含有1-80重量%的活性化合物的制剂形式(例如粉剂、乳剂、流动剂)直接或100-10,000倍稀释后使用,或用作药浴。

- 15 另外,发现本发明活性化合物组合物还对损坏工业材料的昆虫具有很强的杀虫活性。

作为实例并优选列出下述昆虫,但并不限于此:

鞘翅目昆虫,如

- 20 北美家天牛、绿虎天牛(*Chlorophorus pilosis*)、家具窃蠹、报死材窃蠹、类翼窃蠹、*Dendrobium pertinex*、松芽枝窃蠹、松产品窃蠹(*Priobium carpini*)、褐粉蠹、粉蠹(*Lyctus africanus*)、南方粉蠹、栎粉蠹、粉蠹(*Lyctus pubescens*)、胸粉蠹(*Trogoxylon aequale*)、鳞毛粉蠹、材小蠹属、条木小蠹属、咖啡黑长蠹、*Bostrychus capucins*、褐异翅长蠹、棘长蠹属、竹竿粉长蠹。

- 25 革翅目,例如

蓝黑树蜂、云杉大树蜂、泰加大树蜂、大树蜂(*Urocerus augur*)

白蚁,例如

- 30 木白蚁(*Kaloterms flavicollis*)、麻头堆砂白蚁、印巴结构木异白蚁、欧美散白蚁、散白蚁(*Reticulitermes santonensis*)、散白蚁(*Reticulitermes lucifugus*)、达尔文澳白蚁、内华达古白蚁、台湾乳白蚁。

缨尾目,例如台湾衣鱼。

本发明意义上的工业材料可以理解为表示无生命材料,例如优选合成材料、粘合剂、胶、纸和板、皮革、木材、木制品和油漆。

木材以及木制品是特别需要优选保护使其免受昆虫侵袭的材料。

可用本发明组合物或含有本发明组合物的混合物保护的木材和木
5 制品可以理解为表示,例如:

建筑用木材、木梁、铁路轨枕、桥梁组件、桥型码头、木制交通工具、箱子、货架、集装箱、电话线杆、木外罩、木窗和木门、胶合板、粗纸板、在房屋建筑或建筑细木工行业中常用的细木工或木制品。

活性化合物组合物可直接,或以浓缩形式或常规制剂,如粉剂、颗粒剂、溶液、悬浮剂、乳剂或糊剂方式使用。
10

上述制剂可以已知方法制备,例如通过将活性化合物与至少一种溶剂或稀释剂、乳化剂、分散剂和/或粘合剂或固定剂、抗水剂混合,以及如需要加入催干剂和UV稳定剂以及如需要加入染料和颜料,和其它加工助剂。

15 用于保护木材和木制品的杀虫组合物或浓缩物中包括0.0001至95重量%,特别是0.001至60重量%浓度的本发明活性化合物。

组合物或浓缩物的使用量是根据昆虫的种类和个体密度以及介质而确定的。最佳施用量各自可在应用时通过系列试验确定。然而基于需保护的材
20 料,通常使用0.0001至20重量%,优选0.001至10重量%的活性化合物是足够的。

适合的溶剂和/或稀释剂是有机化学溶剂或溶剂混合物和/或低挥发性的油性或油类有机溶剂或溶剂混合物和/或极性有机溶剂或溶剂混合物和/或水,如需要可加入乳化剂和/或湿润剂。

25 优选使用的有机溶剂是油性或油类溶剂,其蒸发值大于35以及闪点大于30℃,并优选大于45℃。用作上述低挥发度以及不溶于水的油性和油类溶剂物质是相应的矿物油或它们的芳族馏分,或含有矿物油的溶剂混合物,优选石油溶剂、石油和/或烷基苯。

30 优选使用沸程为170-220℃的矿物油、沸程为170-220℃的石油溶剂、沸程为250-350℃的锭子油、沸程为160-280℃的石油或芳烃,以及松节油等。

在优选实施方案中,使用沸程为180-210℃的液体脂族烃或沸程为180-220℃的芳族和脂族烃的高沸程混合物和/或锭子油和/或一氯代萘,

优选 α -一氯代萘。

蒸发值大于35以及闪点大于30℃并优选大于45℃的低挥发度的有机油性或油类溶剂可用易或中挥发度的有机溶剂部分替换,条件是溶剂混合物的蒸发值同样大于35以及闪点大于30℃并优选大于45℃,以及该
5 混合物可溶或可乳化于上述溶剂混合物中。

在优选实施方案中,部分有机化学溶剂或溶剂混合物被脂族极性有机化学溶剂或溶剂混合物替代。优选使用含有羟基和/或酯基和/或醚基的脂族有机溶剂,例如乙二醇醚、酯等。

本发明使用的有机化学粘合剂是合成树脂和/或粘合干性油,它们
10 本身已知可用水稀释和/或可溶解或分散或乳化于上述使用的有机化学溶剂中,特别是由下列物质组成的或包含下列物质的粘合剂:丙烯酸树脂、乙烯基树脂,例如聚乙酸乙烯酯、聚酯类树脂、缩聚或加聚树脂、聚氨酯树脂、醇酸树脂或改性的醇酸树脂、酚醛树脂、烃类树脂,如茛
/香豆酮树脂、有机硅树脂、干性植物油和/或干性油和/或基于天然和
15 /或合成树脂的物理干性粘合剂。

用作粘合剂的合成树脂可以乳剂、分散剂或溶液形式使用。沥青或沥青状物质也可用作粘合剂,用量至多为10重量%。还可以使用已知的染料、颜料、防水剂、气味调节剂和抑制剂或防腐剂等。

在本发明组合物或浓缩物中优选包括作为有机化学粘合剂的至少
20 一种醇酸树脂或改性醇酸树脂和/或干性植物油。本发明优选使用含油量大于45重量%,优选50-68重量%的醇酸树脂。

上述粘合剂可全部或部分被固定剂(混合物)或增塑剂(混合物)替代。加入这些添加剂的目的是防止活性化合物的蒸发以及结晶或沉淀。它们优选替代0.01至30%的粘合剂(以使用的粘合剂为100%计)。

增塑剂选自邻苯二甲酸酯类的化学物质,如邻苯二甲酸二丁酯、邻
25 苯二甲酸二辛酯或邻苯二甲酸苄基丁基酯;磷酸酯类如磷酸三丁酯;己二酸酯,如二-(2-乙基己基)己二酸酯;硬脂酸酯,如硬脂酸丁酯或硬脂酸戊酯;油酸酯,如油酸丁酯;甘油醚或高分子量的乙二醇醚;甘油酯和对甲苯磺酸酯。

固定剂在化学上基于聚乙烯烷基醚,如聚乙烯基甲基醚或酮,如二
30 苯甲酮和亚乙基二苯甲酮。

其它适用的溶剂或稀释剂特别是水,任选与一种或多种上述有机化

学溶剂或稀释剂、乳化剂和分散剂混合使用。

特别有效的木材保护方法是通过大批量的浸渍方法,例如通过真空、双真空或加压方法。

同样,本发明的活性化合物组合物可用于保护经常与海水或盐水接触的各种物品,如船体、滤器、网、船体结构、锚和信号装置免受生物附着。

由于定居性寡毛纲目,如龙介虫科以及甲壳类和Ledamorpha(茗荷儿)类,如各种茗荷属和铠茗荷属,或藤壶亚目(藤壶虫),如藤壶属或指茗荷属的附着增加了船体的摩擦阻力并由于增加了能源消耗以及此外经常滞留于船坞,这样明显增加了运营成本。

此外附着生物还有海藻,例如水云属和仙菜属,特别重要的是定居性软甲亚纲(昆甲类)的附着,该昆甲类包括在蔓足纲(蔓足类甲壳动物)中。

令人惊奇地,现已发现本发明活性化合物组合物具有突出的防污(抗植被)作用。

使用本发明化合物组合物时,可以不使用重金属,如,例如硫化二(三烷基锡)、月桂酸三正丁基锡、氯化三正丁基锡、氧化亚铜、氯化三乙基锡、三正丁基(2-苯基-4-氯苯氧基)-锡、氧化三丁基锡、二硫化钼、氧化锑、聚合钛酸丁酯、苯基-(联吡啶)-三氯化铋、氯化三正丁基锡、亚乙基二硫代氨基甲酸锰、二甲基二硫代氨基甲酸锌、亚乙基双硫代氨基甲酸锌、2-吡啶硫醇-1-氧化物的锌和铜盐、双二甲基二硫代氨基甲酸亚铜、硫氰酸铜、环烷酸铜和卤化三丁基锡,或显著降低上述化合物浓度。

即用防污漆还可任选包含其它活性化合物,优选杀藻剂、杀菌剂、除草剂、杀软体动物剂或其它防污活性化合物。

下列组分优选用于本发明防污组合物的混合组分:

杀藻剂,如

2-叔丁基氨基-4-环丙基氨基-6-甲硫基-1,3,5-三嗪、双氯酚、敌草隆、草藻灭、醋酸三苯基锡、异丙隆、噻唑隆、乙氧氟草醚、灭藻醌和特丁净,

杀菌剂,如

苯并[b]噻吩甲酸环己基酰胺-S,S-二氧化物、抑菌灵、Fluorfolpet、3-碘-2-丙炔基丁基氨基甲酸酯、对甲抑菌灵和唑类,如戊环唑、环唑醇、氧唑菌、己唑醇、环戊唑菌、丙环唑和戊唑醇;

杀软体动物剂,如

- 5 醋酸三苯基锡、四聚乙醛、灭虫威、贝螺杀、硫双威和混杀威;或常用防污活性化合物,如

4,5-二氯-2-辛基-4-异噻唑啉-3-酮、二碘甲基paratryl砒、2-(N,N-二甲基硫代氨基甲酰基硫基)-5-硝基噻唑基、2-吡啶硫醇-1-氧化物的钾、铜、钠和锌盐、吡啶三苯基硼烷、四丁基二锡氧烷、2,3,5,6-四氯-4-(甲磺酰基)-吡啶、2,4,5,6-四氯间苯二腈、二硫化四甲基秋兰姆和2,4,6-三氯苯基马来酰亚胺。

使用的防污组合物中包含浓度为0.001至50重量%,特别是0.01至20重量%的本发明活性化合物组合物。

15 本发明防污组合物还包括在下述文献例如 Ungerer, Chem. Ind. 1985, 37, 730-732 和 Williams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973中公开的常用组分。

除了杀藻、杀菌、杀软体动物活性化合物和本发明的杀虫活性化合物外,防污涂料组合物中还特别包括粘合剂。

20 公知的粘合剂的实例包括溶剂体系中的聚氯乙烯、溶剂体系中的氯化橡胶、溶剂体系特别是含水体系中的丙烯酸树脂、水分散体形式或有机溶剂体系形式的氯乙烯/醋酸乙烯酯共聚物体系、丁二烯/苯乙烯/丙烯腈橡胶、干性油,如亚麻子油,树脂酯或与焦油或沥青、柏油以及环氧化合物、少量的氯化橡胶、氯化聚丙烯和乙烯基树脂混合形成的改性硬树脂。

25 涂料中还任选可包含优选不溶于海水的无机颜料、有机颜料或染料。涂料中还可包括如松香类物质,以使活性化合物可控制地释放。此外,涂料中可以包含增塑剂,影响流变性质的改良剂,以及其它常规组分。还可以将本发明化合物或上述混合物加入自抛光防污体系中。

30 活性化合物组合物还适于防治封闭空间,如公寓、厂房、办公室、车厢等空间中发生的有害动物,特别是昆虫、蜘蛛和螨。它们可通过被加入用于防治上述害虫的家用杀虫剂产品中使用。它们对敏感和抗性种群以及所有发育阶段都有杀虫活性。这些有害动物包括:

蝎目,例如钳蝎(*Buthus occitanus*)。

蜱螨目,例如波斯锐缘蜱、翘缘锐缘蜱、苔螨属、鸡皮刺螨、家食甜螨、非洲钝缘蜱、血红扇头蜱、恙螨(*Trombicula alfreddugesi*)、*Neutrombicula autumnalis*、屋尘螨、粉尘螨。

5 蛛形目,例如鸟蛤蛛科、园蛛科。

盲蛛目,例如拟蝎类(*Pseudoscorpiones chelifera*)、*Pseudoscorpiones cheiridium*、*Opiliones phalangium*。

等足目,例如潮虫、鼠妇。

倍足目,例如具斑马陆、山蛩虫属。

10 唇足目,例如地蜈蚣属。

*Zygentoma*目,例如栉衣鱼属、台湾衣鱼、*Lepismodes inquilinus*。

蜚蠊目,例如东方蜚蠊、德国小蠊、小蠊属(*Blattella asahinai*)、马得拉蜚蠊、角腹蠊属、木蠊属、澳洲大蠊、美洲大蠊、褐斑大蠊、黑胸大蠊、长须蜚蠊。

15 跳跃亚目,例如家蟀。

革翅目,例如欧洲球螋。

等翅目,例如木白蚁属、散白蚁属。

啮虫目,例如*Lepinatus*属、粉啮虫属。

鞘翅目,例如圆皮蠹属、毛皮蠹属、皮蠹属、长头谷蠹、隐跗郭公虫属、蛛甲属、谷蠹、谷象、米象、玉米象、药材甲。

20 双翅目,例如埃及伊蚊、白纹伊蚊、*Aedes taeniorhynchus*、按蚊属、红头丽蝇、高额麻蝇、致倦库蚊、尖音库蚊、*Culex tarsalis*、果蝇属、夏厕蝇、家蝇、白蛉属、麻蝇(*Sarcophaga carnaria*)、蚋属、厩螫蝇、大蚊(*Tipula paludosa*)。

25 鳞翅目,例如小蜡螟、蜡螟、印度古斑螟、谷蛾、袋谷蛾、幕谷蛾。

蚤目,例如犬栉首蚤、猫栉首蚤指名亚种、人蚤、穿皮潜蚤、印鼠客蚤。

膜翅目,例如广布弓背蚁、亮毛蚁、黑毛蚁、*Lasius umbratus*、小家蚁、*Paravespula*属、铺道蚁。

30 虱目,例如头虱、体虱、阴虱。

异翅亚目,例如热带臭虫、温带臭虫、长红猎蝽、侵扰锥猎蝽。

它们可以如下述使用: 气溶胶, 非增压喷雾剂, 例如泵喷雾、喷洒

喷雾、烟雾发生器、浓雾、泡沫、凝胶、带有纤维素或聚合物制成的蒸发片的蒸发产品、液体蒸发器、凝胶和薄膜蒸发器、推进式蒸发器、不需能量或被动式蒸发系统、捕蛀虫纸、捕蛾袋和捕虫胶、作为颗粒剂或粉剂、在撒布饵料中或饵料位置。

- 5 根据本发明,可以处理所有植物和植物各部分。此处植物可以理解为所有植物以及植物群落如需要和不需要的野生植物或农作物(包括自然长出的农作物)。农作物可以是通过常规植物育种和优化方法或通过生物技术和重组方法或上述方法的结合获得的植物,包括转基因植物以及包括可获得或不能获得植物品种保护的植物品种,植物的各部分应理
- 10 解为植物的所有地上和地下部分以及器官,如茎、叶、花和根,可提及的实例为叶片、针叶、叶柄、树干、花、子实体、果实、种子、根、块茎和根状茎。植物各部分还包括收获材料以及无性和有性繁殖材料,例如插条、块茎、根状茎、压枝和种子。

- 采用活性化合物进行植物和植物各部分的本发明处理方法是通
- 15 常规处理方法直接施用或将化合物作用于它们的环境、栖息地或贮藏区进行处理,例如浸渍、喷雾、熏蒸、弥雾、撒播、刷涂以及在繁殖材料特别是种子的情况下还可以进行一层或多层包衣。

- 如上所提及,可按照本发明处理所有植物及其各部分。在一个优选的实施方案中,处理已有的或通过常规的生物育种方法,如杂交或原生质体融合得到的植物种类和植物品种和其各部分。在另一个优选的实
- 20 施方案中,处理通过基因工程方法,任选与常规方法联合(基因修饰生物体)得到的转基因植物和植物品种及其各部分。术语“各部分”或“植物的各部分”或“植物部分”在上面已作过解释。

- 按照本发明,特别优选处理在各种情况下市售可得或在使用的
- 25 植物品种的植物。

- 根据植物种类或植物品种、它们的栖息地和生长条件(土壤、气候、植物生长期、营养),按照本发明的处理方法还可导致超加和的(“协同”)作用。因此,例如,可减少用量和/或拓宽活性谱和/或提高本发明所用的物质和组合物的活性、改善植物生长、增强对高或低温的耐受
- 30 性、增强对旱灾或水灾或土壤盐量的耐受性、增加花卉的性能、易于收获、加速成熟、提高收获量、提高收获产品的质量和/或提高产品的营养价值、提高产品的储存稳定性和/或可加工性,这些超出了本身所期

望的效果。

属于按照本发明优选进行处理的转基因植物或植物品种(即通过基因工程得到的那些)包括通过基因材料的基因工程修饰得到的所有植物,所述基因修饰赋予这些植物特别有利的有用的性能(“特性”)。这种性能的例子是较好的植物生长、增强对高或低温的耐受性、增强对旱灾或水灾或土壤盐量的耐受性、增加花卉的性能、易于收获、加速成熟、较高的收获产量、收获产品较好的质量和/或较高的营养价值、收获产品较好的储存稳定性和/或可加工性。进一步和特别强调的所述性能的例子是提高植物对动物和微生物的害虫,如昆虫、螨、植物病菌真菌、细菌和/或病毒的抵御性,以及提高植物对某些除草活性化合物的耐受性。可提及的转基因植物的例子是重要的农作物,如谷类农作物(小麦、稻)、玉米、大豆、土豆、棉花、油菜籽油菜和水果植物(水果为苹果、梨、柑橘属水果和葡萄),特别强调的是玉米、大豆、土豆、棉花和油菜籽油菜。特别强调的特性是通过在植物中产生的毒素,特别是通过来自 *Thuringiensis* 杆菌的基因物质(例如通过基因 CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb 和 CryIF 及它们的联合)(下文称作“Bt 植物”)在植物中产生的那些增强植物对昆虫的抵御。此外,特别强调的特性是植物对某些除草活性化合物,如咪唑啉酮类、磺酰脲类、草甘膦类或膦基麦黄酮(例如“PAT”基因)的增强的耐受性。给予所述的需要的特性的基因也可以在转基因植物中相互联合存在。可提及的“Bt 植物”的例子是以商标名 YIELD GARD®(例如玉米、棉花、大豆)、KnockOut®(例如玉米)、StarLink®(例如玉米)、Bollgard®(棉花)、Nucotn®(棉花)和 Newleaf®(土豆)出售的玉米品种、棉花品种、大豆品种和土豆品种。可提及的耐受除草剂的植物是以商标名 Roundup Ready®(耐受草甘膦,例如玉米、棉花、大豆)、Liberty Link®(耐受膦基麦黄酮,例如油菜籽油菜)、IMI®(耐受咪唑啉酮类)和 STS®(耐受磺酰脲类,例如玉米)出售的玉米品种、棉花品种、大豆品种。可提及的耐除草剂的植物(以常规方式除草剂耐受育种)包括以商标名 Clearfield®(例如玉米)出售的品种。当然,这些叙述也适用于具有所述特性或将来还要改良的基因特性的将来开发的植物或将来投放市场的植物品种。

所列的植物可按照本发明以特别有利的方式用本发明活性化合物

混合物进行处理。上述优选的混合物范围也适用于这些植物的处理。特别强调的是用本文中特别提及的混合物处理植物。

由下列实施例可见本发明活性化合物组合物具有很好的杀虫和杀螨活性。在单个活性化合物表现的活性低的同时,组合物的活性超出了
5 各化合物活性的简单加和。

当活性化合物组合物的活性超出单独施用各活性化合物活性总和时则存在杀虫剂和杀螨剂的增效作用。

根据 S. R. Colby, Weeds 15 (1967), 20-22 文献中如下所示公式可计算给定的两种活性化合物组合物的预期活性:

10 如果

X 代表活性化合物 A 在施用量为 $\underline{m}$ g/ha 或浓度为 $\underline{m}$ ppm 时的死亡率,以未处理对照的%表示,

Y 代表活性化合物 B 在施用量为 $\underline{n}$ g/ha 或浓度为 $\underline{n}$ ppm 时的死亡率,以未处理对照的%表示,以及

15 E 代表活性化合物 A 和 B 在施用量为 $\underline{m}$ 和 $\underline{n}$ g/ha 或浓度为 $\underline{m}$ 和 $\underline{n}$ ppm 时的死亡率,以未处理对照的%表示,

则

$$E = X + Y - (X \cdot Y / 100)$$

如果实际的杀虫致死率超过计算的预期值,那么组合物的活性就是
20 超加和的,即具有增效活性。这种情况下,实际观测的杀死率必须高于按照上述公式计算的预期杀死率(E)的计算值。

实施例 A

临界浓度试验/土壤昆虫-处理转基因植物

25 试验昆虫: 黄瓜条叶甲 (*Diabrotica balteata*)-土壤中的幼虫

溶剂: 7 重量份丙酮

乳化剂: 1 重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

为制备适合的活性化合物制剂,将 1 重量份活性化合物与所述量的溶剂混合,加入给定量的乳化剂,并用水稀释该浓缩物至所需浓度。

30 将所述活性化合物配制品浇到土壤上。对此该配制品中活性化合物的浓度实际不起作用,起决定作用的只是每单位体积的土壤中活性化合物的重量,该重量用 ppm(mg/l)表示。将所述土壤装到 0.25 l 的盆

中并在 20℃保存。

- 在配制完成后直接向各盆中放入 5 粒预发芽的 YIELD GUARD (Monsanto Comp., USA 的商标) 种的玉米粒。两天后向处理过的土壤中放入相应的测试昆虫。再过 7 天后通过计数露出土表的玉米苗
- 5 确定活性化合物的活性程度 (1 棵植物 = 20% 活性)。

实施例 B

烟芽夜蛾 (*Heliothis virescens*) 试验-转基因植物的处理

- 10 溶剂: 7 重量份丙酮

乳化剂: 1 重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

为制备适合的活性化合物制剂, 将 1 重量份活性化合物与上述量的溶剂和乳化剂混合, 并用水稀释浓缩物至所需浓度。

- 将各种 Rundup Ready (Monsanto Comp., USA 的商标) 的大豆嫩枝
- 15 (Glycine max) 通过浸入所需浓度的活性化合物制品中进行处理, 并在大豆页仍然潮湿时放上烟夜蛾烟芽夜蛾 (Tabakknospenraupe *Heliothis virescens*)。

在规定时间内测定昆虫的杀死率。