

硝基，而 1 至 4 个取代基可以从下列取代基中选择：1 至 3 碳的烷基、1 至 3 碳的烷氧基和卤素；而 B 是苯基、氰苯基、硝基苯基、含有 1 至 3 个卤素原子的卤代苯基、3-吡啶基、5-噁唑基，单取代至双取代的 5-噁唑基，该取代基可以选自 1-3 碳的烷基、1-3 碳的卤代烷基、环丙基、卤代环丙基、2-3 碳链烯基、2-3 碳的炔基、1-3 碳的烷氧基、2-3 碳的卤代链烯基、2-3 碳的卤代炔基、1-3 碳卤代烷氧基、1-3 碳烷硫基、1-3 碳卤代烷硫基、烯丙氧基、炔丙氧基、烯丙硫基、炔丙硫基、卤代烯丙氧基、卤代烯丙硫基、卤素、氰基和硝基；或 B 代表被 1 至 2 个基团取代的 3-吡啶基，该取代基可以选自下列基团：1-3 碳卤代烷基、环丙基、卤代环丙基、2-3 碳链烯基、2-3 碳的炔基、2-3 碳的卤代烯基、2-3 碳的卤代炔基、1-3 碳的卤代烷氧基、1-3 碳的烷硫基、1-3 碳卤代烷硫基、烯丙氧基、炔丙氧基、烯丙硫基、炔丙硫基、卤代烯丙氧基、卤代烯丙硫基、氰基或硝基；或被 1 至 4 个基团取代的 3-吡啶基，该取代基可以选自 1-3 碳的烷基，1-3 碳烷氧基或卤素；下列化合物除外：

1-硝基-2(吡啶-3-基甲基)胍，1-硝基-2(吡啶-2-基甲基)胍，1-硝基-2-(吡啶-4-基甲基)胍，1-硝基-2-(1-氧代吡啶-3-基甲基)胍和 1-(苯并咪唑-2-基甲基)-2-硝基胍。

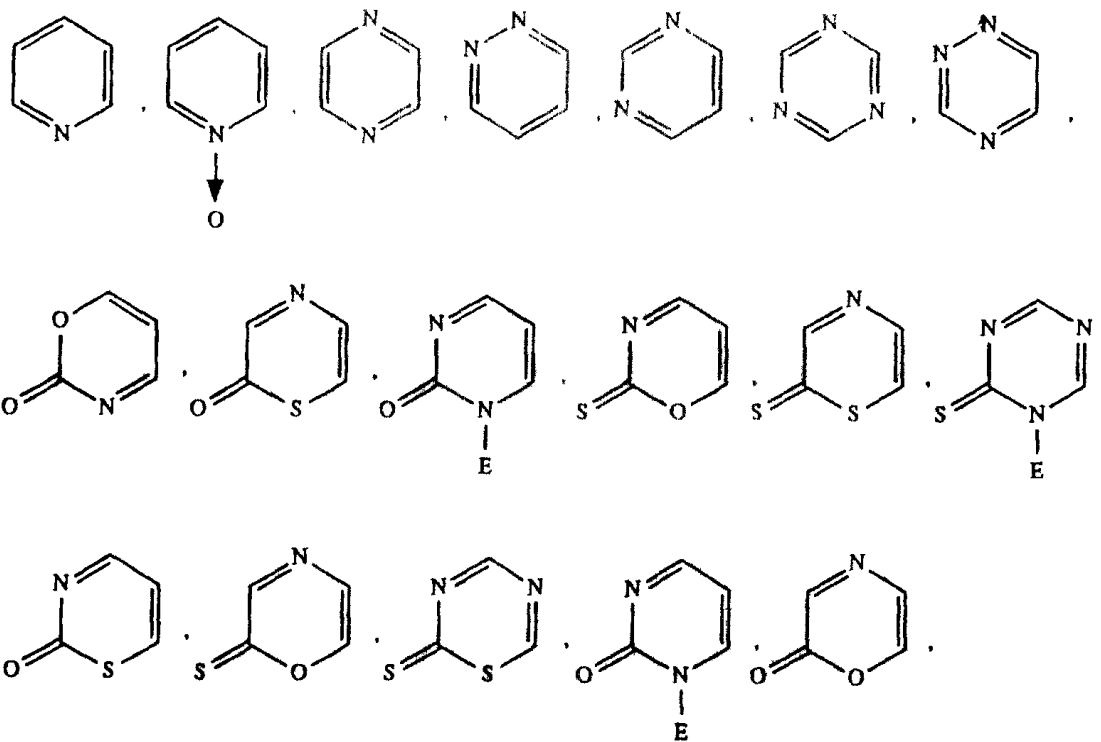
2. 根据权利要求 1 要求的化合物，其中杂环取代基 A 是未饱和的，至少含有一个氮原子，并通过一个碳原子键合到分子式 I 的硝基胍基体上。

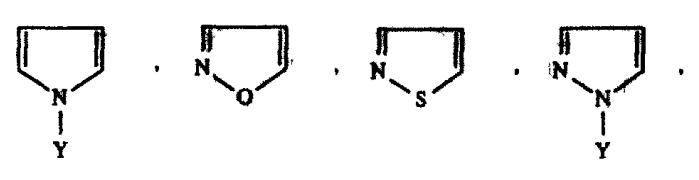
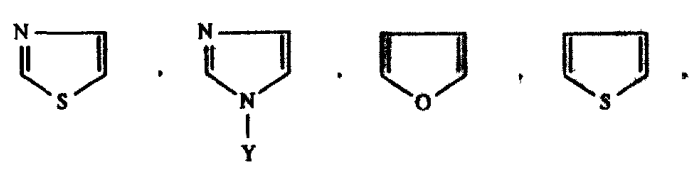
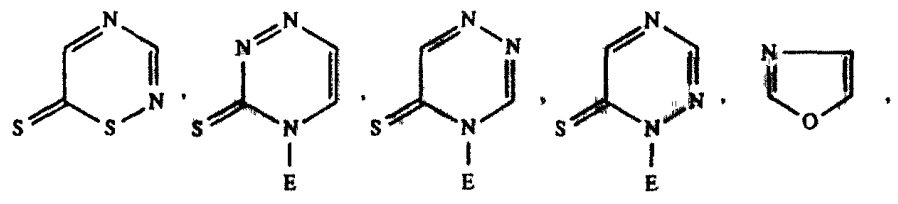
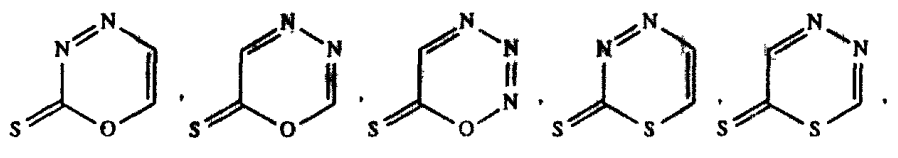
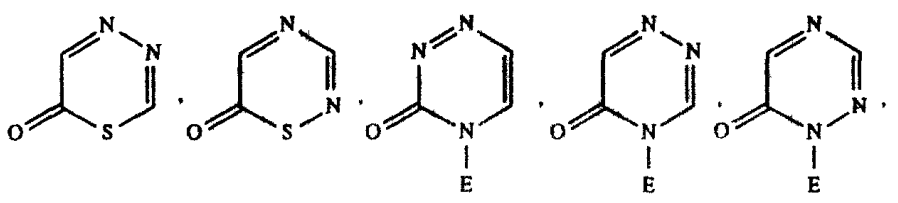
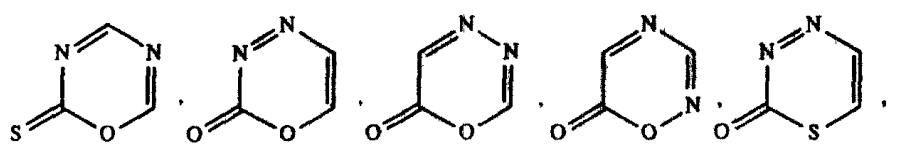
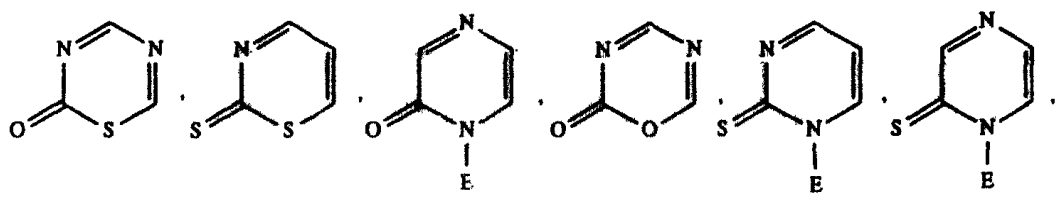
3. 根据权利要求 2 要求的化合物，其中杂环取代基 A 是未饱和

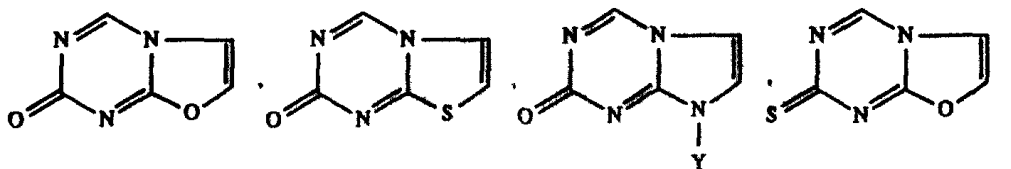
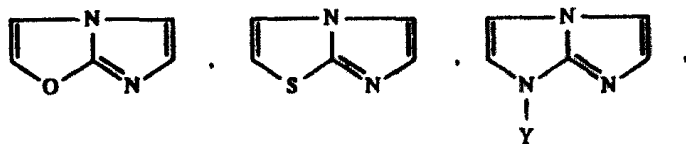
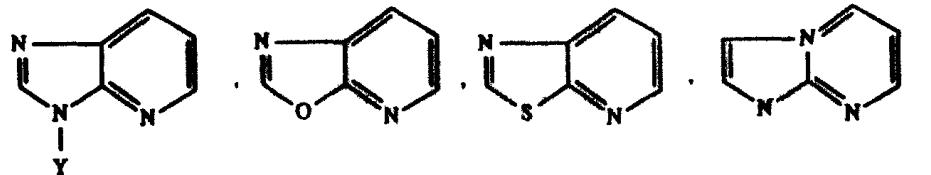
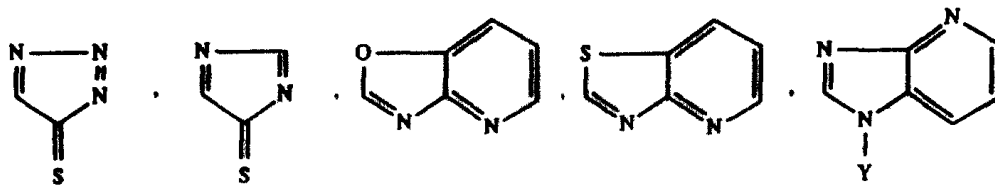
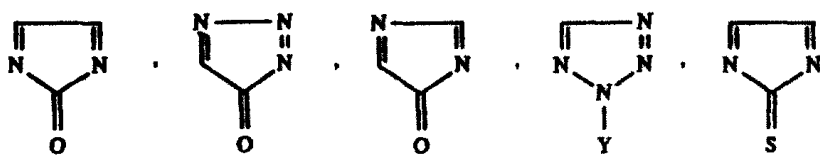
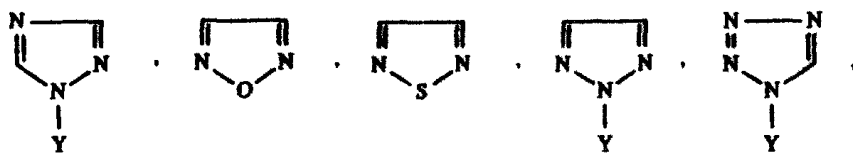
的，通过一个碳原子键合到硝基胍本体上，含有一至三个氧，硫和氮杂原子，其中氧或硫最多是一个。

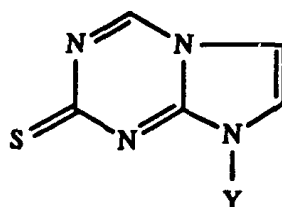
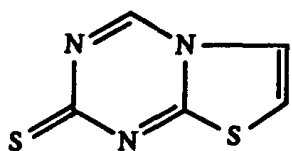
4. 根据权利要求3要求的化合物，其中杂环取代基A含有一至三个氧、硫和氮杂原子，A中总有一个氮原子，氧或硫原子不多于一个。

5. 根据权利要求1要求的化合物，其中杂环取代基A是一种碱性体，通过一个碳原子键合到胍上，如下列基团









其中碱性体是非饱和的，按照环体系取代的可能性，或可取代上高达4个权利要求1定义的取代基，其中E是1—3碳的烷基，Y是氢，1—3碳烷基或环丙基。

6. 根据权利要求5要求的化合物，其中杂环取代基A是未取代的或取代上一至三个取代基，这些取代基可以是卤素，1—3碳烷基，1—3碳卤代烷基，1—3碳卤代烷氧基或1—3碳烷氧基。

7. 根据权利要求6要求的化合物，其中杂环取代基A是吡啶基或噻唑基。

8. 根据权利要求1要求的化合物，其中基团B是苯，吡啶或噻唑基，它们各自可以是非取代的，单取代的或二取代的，取代基是卤素，1—3碳烷基，1—3碳卤代烷基，1—3碳卤代烷氧基或1—3碳烷氧基。

9. 根据权利要求7要求的化合物，其中A是3—吡啶基，2—卤代吡啶—5—基，2，3—二卤代吡啶—5—基或2—卤代噻唑—4—基，1—氧代吡啶—3—基，1—氧代—2—卤代吡啶—5—基或1—氧代—2，3—二卤代吡啶—5—基。

10. 按照权利要求1要求的化合物, 其中 R_1 和 R_2 互不相干, 可以是氢, 甲基, 乙基或环丙基, R_3 是氢, R_4 是氢或甲基, A是吡啶基, 1-氧代吡啶基, 噻唑基或吡啶基, 1-氧代吡啶基或噻唑基, 每一个基团又被一至三个取代基取代, 这些取代基是卤素, 1-3碳烷基, 1-3碳卤代烷基, 1-3碳卤代烷氧基或1-3烷碳氧基。

11. 按照权利要求1要求的化合物, 可从下列化合物中选择

1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-1-甲基-2-硝基胍,

1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-2-硝基胍,

1-甲基-2-硝基-3-(吡啶-3-基甲基)胍,

1-甲基-2-硝基-1-(吡啶-3-基甲基)胍,

1, 2-二甲基-3-硝基-1-(吡啶-3-基甲基)胍,

1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-1, 2-二甲基-3-硝基胍,

1-(2-氯噻唑-5-基甲基)-1-甲基-2-硝基胍,

1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-2, 2-二甲基-3-硝基胍,

1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-2-甲基-3-硝基胍,

1, 1-二甲基-2-硝基-3-(吡啶-3-基甲基)胍,

1-乙基-2-硝基-3-(吡啶-3-基甲基)胍,

1-乙基-2-(2-氯吡啶-5-基甲基)-3-硝基胍,

1-乙基-1-甲基-2-(2-氯吡啶-5-基甲基)-3-硝基胍,

1-(2-氯噻唑-5-基甲基)-2, 2-二甲基-3-硝基胍,

1-(2, 3-二氯吡啶-5-基甲基)-2-甲基-3-硝基胍,

1-乙基-2-(2, 3-二氯吡啶-5-基甲基)-3-硝基胍,

1-(2, 3-二氯吡啶-5-基甲基)-1-甲基-2-硝基胍,

1-乙基-1-(2, 3-二氯吡啶-5-基甲基)-2-硝基胍,

1-(2-氯-1-氧代吡啶-5-基甲基)-1-甲基-2-硝基胍,

1-乙基-1-(2-氯-1-氧代吡啶-5-基甲基)-2-硝基胍,

1-(2-氯-1-氧代吡啶-5-基甲基)-2-甲基-3-硝基胍,

1-乙基-1-(2-氯-1-氧代吡啶-5-基甲基)-3-硝基胍,

1-(2-氯噻唑-5-基甲基)-2-甲基-3-硝基胍,

1-(2-氯噻唑-5-基甲基)-2-硝基胍和

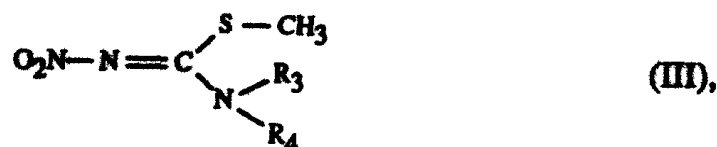
1-乙基-2-(2-氯噻唑-5-基甲基)-3-硝基胍。

12. 制备按权利要求1要求的具有分子式I的硝基胍的方法, 可以是a)或b),

a)具有分子式II的胺



在碱存在的条件下与具有分子式 III 的硝基异硫脲反应



分子式中 R_1 , R_2 , R_3 和 A 的意义与分子式 I 所给的相同。

b) 具有分子式 N 的化合物



在碱存在下与具有分子式 V 的硝基胍衍生物反应

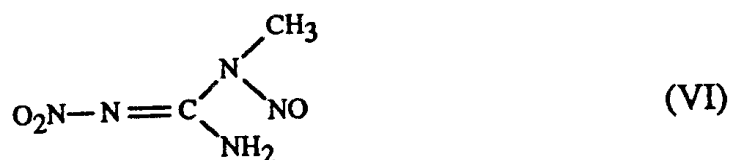


分子式中 R_1 , R_2 , R_3 , R_4 和 A 的意义与分子式 I 所给的相同, Hal 是卤素, 最好是氯和溴。

13. 具有分子式 I 化合物的制备方法, 其中 R_3 和 R_4 是氢, 这个制备方法是使一个具有分子式 II 的胺



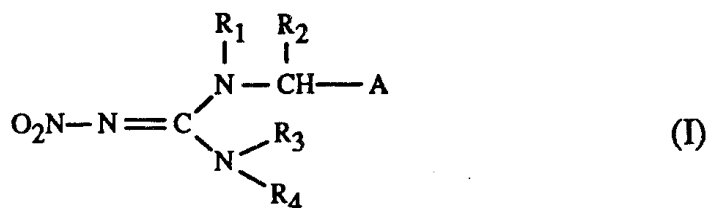
式中 R_1 , R_2 和 A 的意义与分子式 I 所给的相同, 与具有分子式 VI 的 1-甲基-1-亚硝基-2-硝基胍反应



或者与具有分子式 VII 的硝基胍反应。



14. 含有至少一种式 I 的硝基胍或它们与无机酸形成的盐做有效成分的杀虫剂

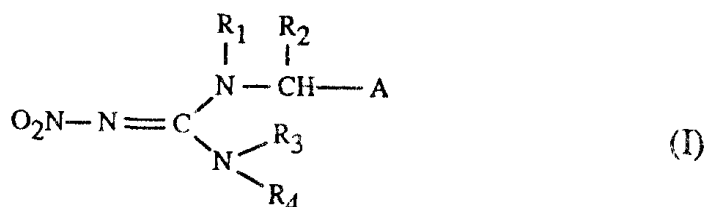


式中 R_1 是氢、1至4碳的烷基或3至6碳的环烷基; R_2 是氢或1至4碳的烷基; R_3 是氢、1至4碳的烷基或3至6碳的环烷基; R_4

是氢、1至4碳的烷基、3至6碳的环烷基或 $-\text{CHR}_5-\text{B}$ 基团，或者 R_3 和 R_4 联在一起是 $-(\text{CH}_2)_4-$ 或 $-(\text{CH}_2)_5-$ ， R_5 是氢或1至4碳的烷基；A是非取代、或单取代至四取代芳基或非芳基、单环或双环杂环基团，其中1至2个取代基可从下列取代基中选择：1至3碳的卤代烷、环丙基、卤代环丙基、2至3碳链烯基、2至3碳的炔基、2至3碳的卤代烯基、2至3碳的卤代炔基、1至3碳的卤代烷氧基、1至3碳的烷硫基、1至3碳的卤代烷硫基、烯丙氧基、炔丙氧基、烯丙硫基、炔丙硫基、卤代烯丙氧基、卤代烯丙硫基、氰基和硝基，而1至4个取代基可以从下列取代基中选择：1至3碳的烷基、1至3碳的烷氧基和卤素；而B是苯基、氰苯基、硝基苯基、含有1至3个卤素原子的卤代苯基、3-吡啶基、5-噻唑基，单取代至双取代的5-噻唑基，该取代基可以选自1-3碳的烷基、1-3碳的卤代烷基、环丙基、卤代环丙基、2-3碳链烯基、2-3碳的炔基、1-3碳的烷氧基、2-3碳的卤代链烯基、2-3碳的卤代炔基、1-3碳卤代烷氧基、1-3碳烷硫基、1-3碳卤代烷硫基、烯丙氧基、炔丙氧基、烯丙硫基、炔丙硫基、卤代烯丙氧基、卤代烯丙硫基、卤素、氰基和硝基；或B代表被1至2个基团取代的3-吡啶基，该取代基可以选自下列基团：1-3碳卤代烷基、环丙基、卤代环丙基、2-3碳链烯基、2-3碳的炔基、2-3碳的卤代烯基、2-3碳的卤代炔基、1-3碳的卤代烷氧基、1-3碳的烷硫基、1-3碳的卤代烷硫基、烯丙氧基、炔丙氧基、烯丙硫基、炔丙硫基、卤代烯丙氧基、卤代烯丙硫基、氰基或硝基；或被1至4个基团取代的3-吡啶基，该取代基可以选自1-3碳的烷基、1-3碳烷氧基或卤素；

15. 按照权利要求14要求的组合物, 在此组合物中除了具有分子式I的有效物质外, 至少有一种其他载体。

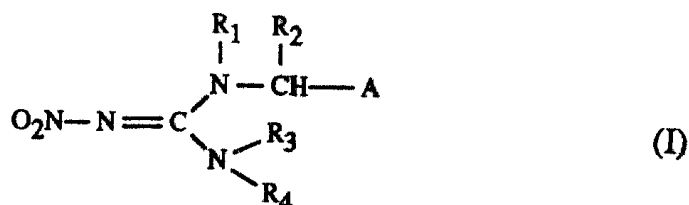
16. 控制对动物和植物有害的害虫和蛛网动物的方法, 本方法使用一定有效量的具有分子式I的硝基胍以及它们与无机酸形成的盐处置害虫和它们的环境,



式中 R_1 是氢、1至4碳的烷基或3至6碳的环烷基; R_2 是氢或1至4碳的烷基; R_3 是氢、1至4碳的烷基或3至6碳的环烷基; R_4 是氢、1至4碳的烷基、3至6碳的环烷基或 $-\text{CHR}_5-\text{B}$ 基团, 或者 R_3 和 R_4 联在一起是 $-(\text{CH}_2)_4-$ 或 $-(\text{CH}_2)_5-$; R_5 是氢或1至4碳的烷基; A 是非取代、或单取代至四取代芳基或非芳基、单环或双环杂环基团, 其中1至2个取代基可从下列取代基中选择: 1至3碳的卤代烷、环丙基、卤代环丙基、2至3碳链烯基、2至3碳的炔基、2至3碳的卤代烯基、2至3碳的卤代炔基、1至3碳的卤代烷氧基、1至3碳的烷硫基、1至3碳的卤代烷硫基、烯丙氧基、炔丙氧基、烯丙硫基、炔丙硫基、卤代烯丙氧基、卤代烯丙硫基、氰基和

硝基，而 1 至 4 个取代基可以从下列取代基中选择：1 至 3 碳的烷基、1 至 3 碳的烷氧基和卤素；而 B 是苯基、氟苯基、硝基苯基、含有 1 至 3 个卤素原子的卤代苯基、3-吡啶基、5-噻唑基，单取代至双取代的 5-噻唑基，该取代基可以选自 1-3 碳的烷基、1-3 碳的卤代烷基、环丙基、卤代环丙基、2-3 碳链烯基、2-3 碳的炔基、1-3 碳的烷氧基、2-3 碳的卤代链烯基、2-3 碳的卤代炔基、1-3 碳卤代烷氧基、1-3 碳烷硫基、1-3 碳卤代烷硫基、烯丙氧基、炔丙氧基、烯丙硫基、炔丙硫基、卤代烯丙氧基、卤代烯丙硫基、卤素、氟基和硝基；或 B 代表被 1 至 2 个基团取代的 3-吡啶基，该取代基可以选自下列基团：1-3 碳卤代烷基、环丙基、卤代环丙基、2-3 碳链烯基、2-3 碳的炔基、2-3 碳的卤代烯基、2-3 碳的卤代炔基、1-3 碳的卤代烷氧基、1-3 碳的烷硫基、1-3 碳的卤代烷硫基、烯丙氧基、炔丙氧基、烯丙硫基、炔丙硫基、卤代烯丙氧基、卤代烯丙硫基、氟基或硝基；或被 1 至 4 个基团取代的 3-吡啶基，该取代基可以选自 1-3 碳的烷基，1-3 碳烷氧基或卤素；

17. 具有分子式 I 硝基胍以及它们与无机酸形成的盐在控制动物和植物上的害虫上的应用，此硝基胍的分子式为：



式中 R_1 是氢、1 至 4 碳的烷基或 3 至 6 碳的环烷基； R_2 是氢或 1 至 4 碳的烷基； R_3 是氢、1 至 4 碳的烷基或 3 至 6 碳的环烷基； R_4

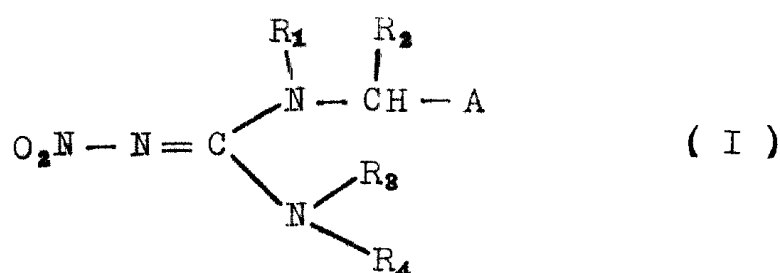
是氢、1至4碳的烷基、3至6碳的环烷基或 $-\text{CHR}_5-\text{B}$ 基团,或者 R_3 和 R_4 联在一起是 $-(\text{CH}_2)_4-$ 或 $-(\text{CH}_2)_5-$, R_5 是氢或1至4碳的烷基; A是非取代、或单取代至四取代芳基或非芳基、单环或双环杂环基团,其中1至2个取代基可从下列取代基中选择: 1至3碳的卤代烷、环丙基、卤代环丙基、2至3碳链烯基、2至3碳的炔基、2至3碳的卤代烯基、2至3碳的卤代炔基、1至3碳的卤代烷氧基、1至3碳的烷硫基、1至3碳的卤代烷硫基、烯丙氧基、炔丙氧基、烯丙硫基、炔丙硫基、卤代烯丙氧基、卤代烯丙硫基、氰基和硝基,而1至4个取代基可以从下列取代基中选择: 1至3碳的烷基、1至3碳的烷氧基和卤素; 而B是苯基、氰苯基、硝基苯基、含有1至3个卤素原子的卤代苯基、3-吡啶基、5-噻唑基,单取代至双取代的5-噻唑基,该取代基可以选自1-3碳的烷基、1-3碳的卤代烷基、环丙基、卤代环丙基、2-3碳链烯基、2-3碳的炔基、1-3碳的烷氧基、2-3碳的卤代链烯基、2-3碳的卤代炔基、1-3碳卤代烷氧基、1-3碳烷硫基、1-3碳卤代烷硫基、烯丙氧基、炔丙氧基、烯丙硫基、炔丙硫基、卤代烯丙氧基、卤代烯丙硫基、卤素、氰基和硝基; 或B代表被1至2个基团取代的3-吡啶基,该取代基可以选自下列基团: 1-3碳卤代烷基、环丙基、卤代环丙基、2-3碳链烯基、2-3碳的炔基、2-3碳的卤代烯基、2-3碳的卤代炔基、1-3碳的卤代烷氧基、1-3碳的烷硫基、1-3碳的卤代烷硫基、烯丙氧基、炔丙氧基、烯丙硫基、炔丙硫基、卤代烯丙氧基、卤代烯丙硫基、氰基或硝基; 或被1至4个基团取代的3-吡啶基,该取代基可以选自1-3碳的烷基,1-3碳烷氧基或卤素;

18. 依权利要求17的应用, 其中的害虫是对植物有害的昆虫和蛛纲动物。

胍衍生物

本发明涉及新的硝基胍衍生物，这些硝基胍衍生物的制备方法，含有这些化合物的杀虫剂，以及它们在控制害虫方面的应用。

按照本发明，硝基胍的分子式为



式中 R_1 是氢、1至4碳的烷基或3至6碳的环烷基； R_2 是氢或1至4碳的烷基； R_3 是氢、1至4碳的烷基或3至6碳的环烷基； R_4 是氢、1至4碳的烷基、3至6碳的环烷基或 $-\text{CHR}_5-\text{B}$ 基团，或者 R_3 和 R_4 联在一起是 $-(\text{CH}_2)_4-$ 或 $-(\text{CH}_2)_5-$ ； R_5 是氢或1至4碳的烷基；A 是非取代、或单取代至四取代芳基或非芳基、单环或双环杂环基团，其中1至2个取代基可从下列取代基中选择：1至3碳的卤代烷、环丙基、卤代环丙基、2至3碳链烯基、2至3碳的炔基、2至3碳的卤代烯基、2至3碳的卤代炔基、1至3碳的卤代烷氧基、1至3碳的烷硫基、1至3碳的卤代烷硫基、烯丙氧基、炔丙氧基、烯丙硫基、炔丙硫基、卤代烯丙氧基、卤代烯丙硫基、氰基和

硝基，而 1 至 4 个取代基可以从下列取代基中选择：1 至 3 碳的烷基、1 至 3 碳的烷氧基和卤素；而 B 是苯基、氟苯基、硝基苯基、含有 1 至 3 个卤素原子的卤代苯基、3-吡啶基、5-噻唑基，单取代至双取代的 5-噻唑基，该取代基可以选自 1-3 碳的烷基、1-3 碳的卤代烷基、环丙基、卤代环丙基、2-3 碳链烯基、2-3 碳的炔基、1-3 碳的烷氧基、2-3 碳的卤代链烯基、2-3 碳的卤代炔基、1-3 碳卤代烷氧基、1-3 碳烷硫基、1-3 碳卤代烷硫基、烯丙氧基、炔丙氧基、烯丙硫基、炔丙硫基、卤代烯丙氧基、卤代烯丙硫基、卤素、氟基和硝基；或 B 代表被 1 至 2 个基团取代的 3-吡啶基，该取代基可以选自下列基团：1-3 碳卤代烷基、环丙基、卤代环丙基、2-3 碳链烯基、2-3 碳的炔基、2-3 碳的卤代烯基、2-3 碳的卤代炔基、1-3 碳的卤代烷氧基、1-3 碳的烷硫基、1-3 碳的卤代烷硫基、烯丙氧基、炔丙氧基、烯丙硫基、炔丙硫基、卤代烯丙氧基、卤代烯丙硫基、氟基或硝基；或被 1 至 4 个基团取代的 3-吡啶基，该取代基可以选自 1-3 碳的烷基，1-3 碳烷氧基或卤素；这些硝基胍也可以与无机酸形成相应的盐；下列化合物除外：

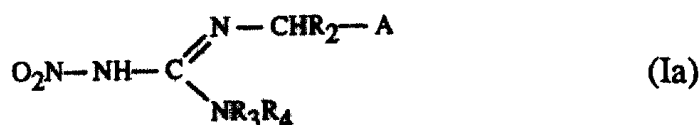
1-硝基-2-(吡啶-3-基甲基)胍，1-硝基-2-(吡啶-2-基甲基)胍，1-硝基-2-(吡啶-4-基甲基)胍，1-硝基-2-(1-氧代吡啶-3-基甲基)胍和 1-(苯并咪唑-2-基甲基)-2-硝基胍。

从文献查得的、含有硝基胍结构的杂环化合物是来自有关杀虫剂方面的 EP-A-192,060。然而，这些化合物的生物学性质在害虫控制方面并不是十分令人满意的。在该文献中，不在分子式 I 定义范围内的各个化合物被描述成有药物活性的化合物的中间体，该

化合物具有防白血病及抗细菌的作用。这些化合物也具有分子式 I 所特有的生物学性质。当这些化合物在农用化学药品中使用或作为农用化学药品中的有效成分时，它们也是本发明的一个内容。

根据本发明分子式 I 的化合物也包括它与适于农用的无机酸所形成的盐。例如这些酸是盐酸，氢溴酸，硫酸，磷酸和硝酸，以及与上述酸具有相同中心原子，而具有较高或较低的氧化态的酸，如高氯酸，亚硝酸或亚磷酸。

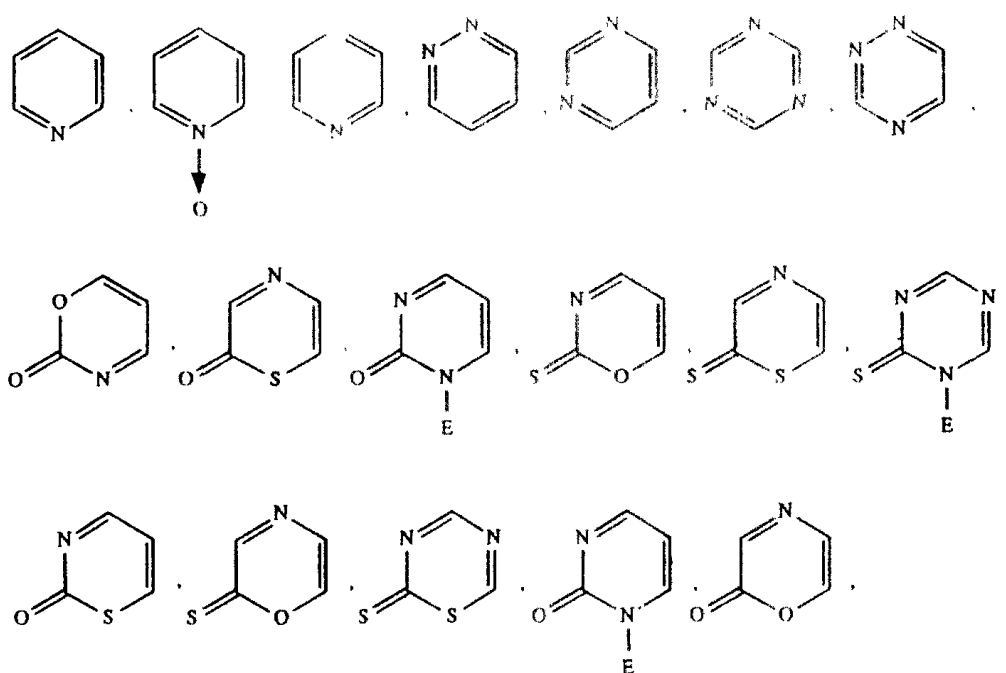
如果 R_1 ， R_3 或 R_4 至少有一个是氢，分子式 I 化合物也能以 I_a 或 I_b 互变异构形式存在

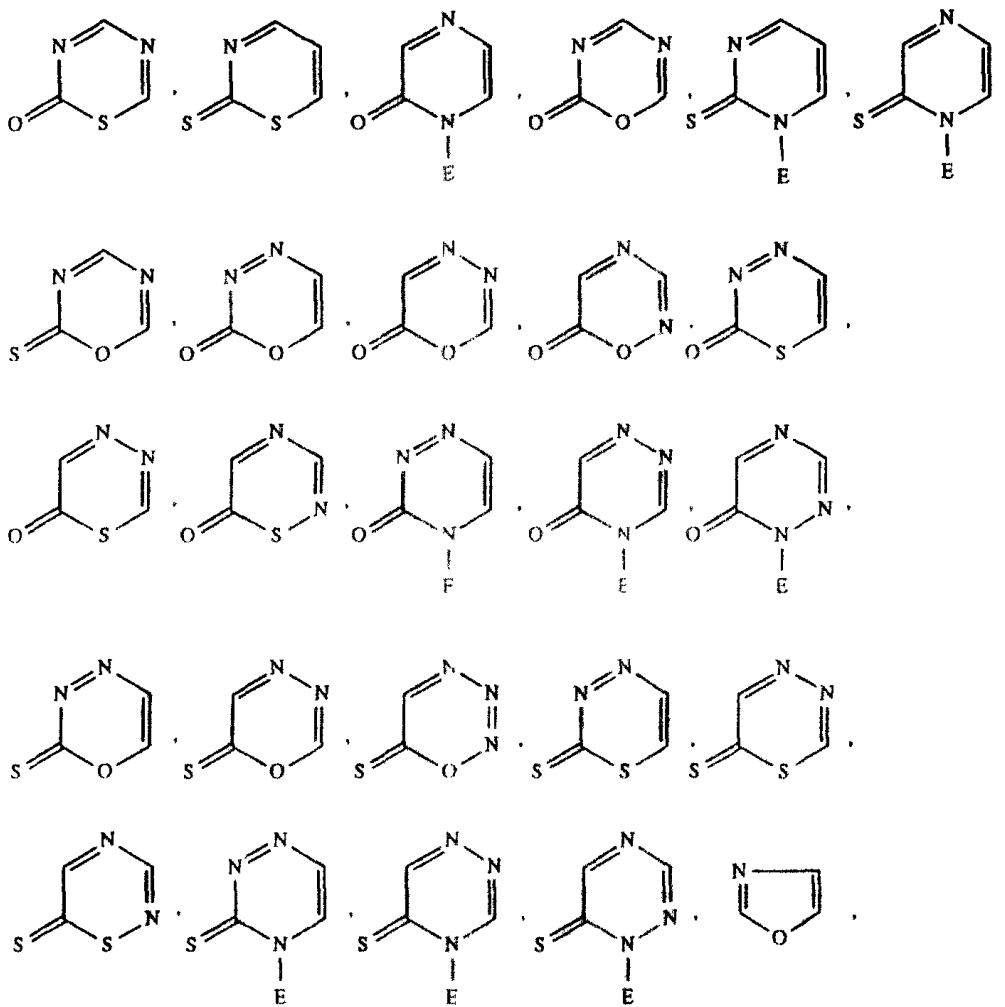


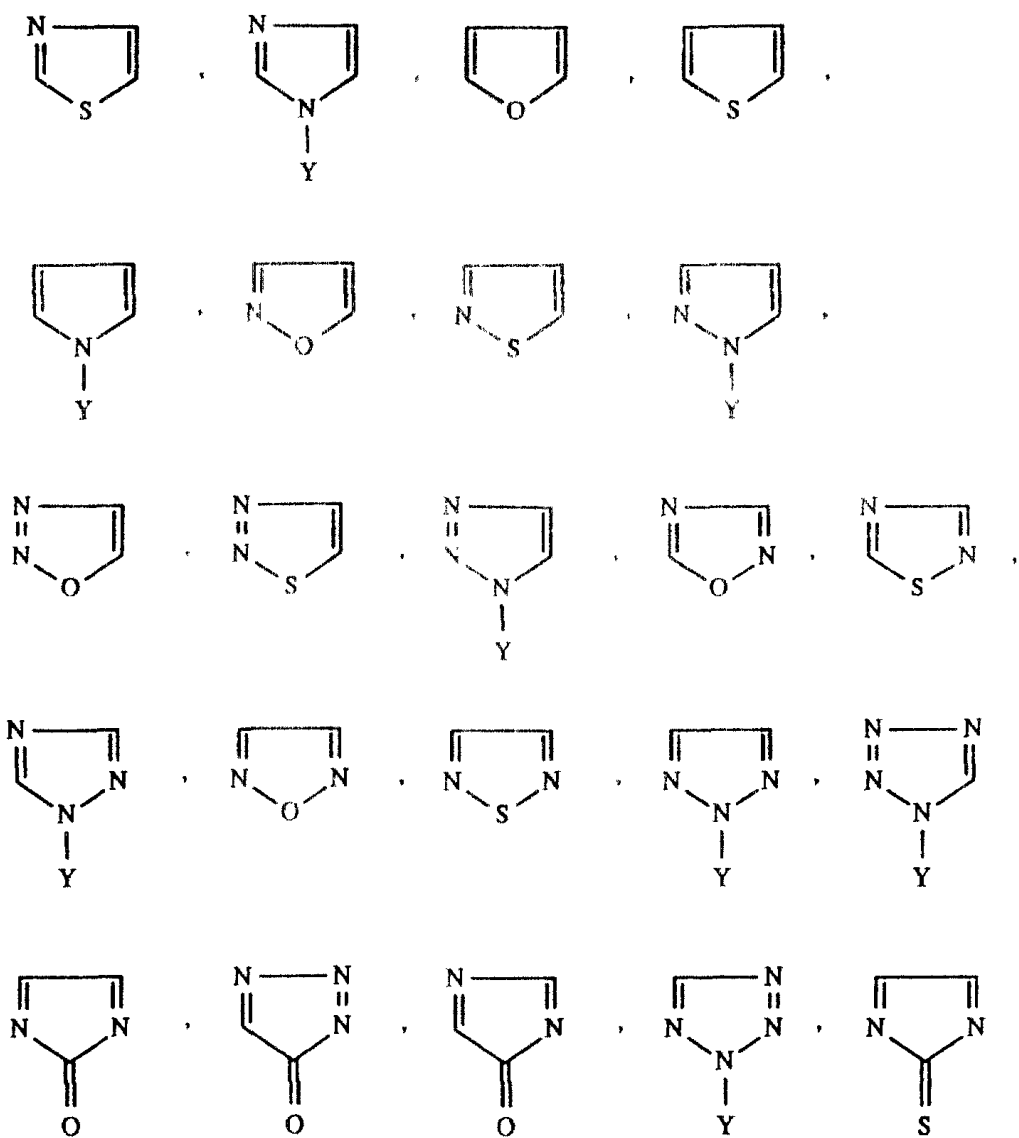
按照本发明，分子式 I 在这里可理解为它包含了 I_a 和 I_b 两种形式。

包含在杂环基团 A 的定义中的环体系至少包含一个杂原子作为环的一员，即至少构成环骨架的原子中有一个不是碳原子。原则上，元素周期表上所有能够形成至少 2 个共价键的原子能够作为环的成员，在这种情况下杂环基团最好是未饱和的并通过环上的一个碳原子键合到分子式 I 中的硝酸胍基体上。定义 A 中的未饱和环体系含有一个或

更多的双键，这些环体系最好是未饱和的体系，一般有芳香特性。环体系最好是含有至少一个氮原子作杂原子。定义A的环通常包括1至3个杂原子，如氧，硫和氮，在所有情况下，氧和硫最多是1个。优选构成A的环体系是含有1至3个选自氧，硫和氮杂原子的杂环基团A，其中的一个杂原子总为氮原子，而氧原子或硫原子最多是1个。特别是下列结构基团给出了按本发明定义的A杂环的例子：







在上面分子式中，E是1-3碳的烷基而Y是氢、1-3碳烷基或环丙基。

作为例子而列出的杂环化合物A按照环体系取代的可能性，可以是未取代的，也可以是象分子式I说明的那样取代至4个取代基。这些杂环最好通过一个碳原子键合到环本体上，它们或是非取代的或是带有1至4个取代基，这些取代基是卤素、1-3碳烷基、1-3碳卤代烷基、1-3碳卤代烷氧基或1-3碳烷氧基。非常好的杂环A是吡啶基或噻唑基，例如3-吡啶基、2-卤代吡啶-5-基、2,3-二卤代吡啶-5-基、2-卤代噻唑-4-基、1-氧代吡啶-3-基、1-氧代-2-卤代吡啶-5-基和1-氧代-2,3-二卤代吡啶-5-基。

按照本发明分子式I的定义，各个总称性术语解释如下：

适于做取代基的卤素原子是氟和氯及溴和碘，最好是氟、氯和溴。这里卤素原子可以独立做取代基团，也可以做取代基的一部分如卤代烷基、卤代烷硫基、卤代烷氧基、卤代环烷基、卤代链烯基、卤代炔基、卤代烯丙氧基或卤代烯丙硫基。适合于做取代基的烷基、烷硫基、链烯基、炔基和烷氧基基团可以是链的或支链的。例如可提及的烷基是甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基。尤其值得一提的合适的烷氧基基团是：甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、或丁氧基或它们的异构体。烷硫基举例如下：甲硫基、乙硫基、异丙硫基、丙硫基、或丁硫基的异构体。如果适用于作取代基的烷基、烷氧基、链烯基、炔基或环烷基被卤素取代，那么，它们可以是部分被卤化甚至全卤化，在这种情况下上面所给的定义适用于卤素、烷基和烷氧基。例如上组中的烷基是甲基、甲基可被氟、

氯或溴单取代至三取代，例如 CHF_2 或 CF_3 ；乙基可以由氟、氯或溴单取代至五取代，例如 CH_2CF_3 ， CF_2CF_3 ， CF_2CCL_3 ， CF_2CHCL_2 ， CF_2CHF_2 ， CF_2CFCL_2 ， CF_2CHBr_2 ， CF_2CHCLF ， CF_2CHBrF 或 CClFCHClF ；丙基或异丙基都可以由氟、氯或溴从单取代到七取代，例如 $\text{CH}_2\text{CHBrCH}_2\text{Br}$ ， $\text{CF}_2\text{CHFCH}_2\text{F}$ ， $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 或 $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$ ；丁基及其异构体可由氟、氯或溴从单取代到九取代，例如 $\text{CF}(\text{CF}_3)\text{CHFCH}_2\text{F}$ 或 $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$ ；2-氯环丙基或 2, 2-二氯环丙基；2, 2-二氯乙烯基，2, 2-二氯乙炔基，2-氯烷基，2, 3-二氯乙炔基或 2, 3-二溴乙炔基。

如果定义的烷基、烷氧基或环烷基由其他取代基所取代，它们可以被单取代或多取代，其取代基可以是所提及的同一种基团，也可以是不同的基团。优选的是，在被取代基中还有一或两个取代基。适于做取代基的环烷基如环丙基，环丁基，环戊基及环己基。烯基或炔基基团含有一个未饱和的碳-碳键。典型的代表是烯丙基，甲基烯丙基或炔丙基，但也有乙烯基和乙炔基。在烯丙氧基，炔丙氧基，烯丙硫基或炔丙硫基中的双键或三键是与联接杂原子(O或S)的位置分开的；这些杂原子最好由饱和碳原子联接。

在具有分子式 I 的化合物中，还必须强调的次级基团是：

- a) 互相独立的 R_1 和 R_2 是氢、甲基、乙基或环丙基，或是
- b) R_2 是氢，或
- c) R_4 是氢或甲基。

在 R_4 是 $-\text{CHR}_5-\text{B}$ 的情况下， R_5 最好是氢。B 最好是苯基、吡啶基或噻唑基，它们可以是未取代的或由一个至三个基团取代的，这

些取代基团包括卤素、1-3碳烷基、1-3碳卤代烷基、1-3碳卤代烷氧基或1-3碳烷氧基。

在特别推荐的式I化合物中， R_1 和 R_3 相互独立，可以是氢、甲基、乙基或环丙基， R_2 是氢， R_4 是氢或甲基，A是吡啶基、噻唑基、或吡啶基、1-氧代吡啶或噻唑基，它们分别是由一个到三个取代基取代的，这些取代基有卤素、1-3碳烷基、1-3碳卤代烷基、1-3碳卤代烷氧基或1-3碳烷氧基。

下面是一些优选的式I化合物：

1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-1-甲基-2-硝基胍，

1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-2-硝基胍，

1-甲基-2-硝基-3-(吡啶-3-基甲基)胍，

1-甲基-2-硝基-1-(吡啶-3-基甲基)胍，

1,2-二甲基-3-硝基-1-(吡啶-3-基甲基)胍，

1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-1,2-二甲基-3-硝基胍，

1-(2-氯噻唑-5-基甲基)-1-甲基-2-硝基胍，

1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-2,2-二甲基-3-硝基胍，

1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-2-甲基-3-硝基胍，

1,1-二甲基-2-硝基-3-(吡啶-3-基甲基)胍，

1-乙基-2-硝基-3-(吡啶-3-基甲基)胍，

1-乙基-2-(2-氯吡啶-5-基甲基)-3-硝基胍，

1-乙基-1-甲基-2-(2-氯吡啶-5-基甲基)-3-硝基胍，

1-(2-氯噻唑-5-基甲基)-2,2-二甲基-3-硝基胍,

1-(2,3-二氯吡啶-5-基甲基)-2-甲基-3-硝基胍,

1-乙基-2-(2,3-二氯吡啶-5-基甲基)-3-硝基胍,

1-(2,3-二氯吡啶-5-基甲基)-1-甲基-2-硝基胍,

1-乙基-1-(2,3-二氯吡啶-5-基甲基)-2-硝基胍,

1-(2-氯-1-氧代吡啶-5-基甲基)-1-甲基-2-硝基胍,

1-乙基-1-(2-氯-1-氧代吡啶-5-基甲基)-2-硝基胍,

1-(2-氯-1-氧代吡啶-5-基甲基)-2-甲基-3-硝基胍,

1-乙基-1-(2-氯-1-氧代吡啶-5-基甲基)-3-硝基胍,

1-(2-氯噻唑-5-基甲基)-2-甲基-3-硝基胍,

1-(2-氯噻唑-5-基甲基)-2-硝基胍和

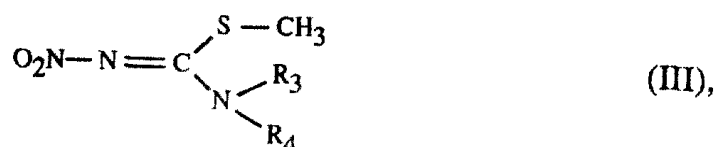
1-乙基-2-(2-氯噻唑-5-基甲基)-3-硝基胍。

按照本发明分子式 I 的化合物可按类似于已知的方法制备。例如具有分子式 I 的化合物可用下面任一方法获得：

a) 一个具有分子式 II 的胺



与分子式 III 的硝基异硫脲在碱存在的条件下反应

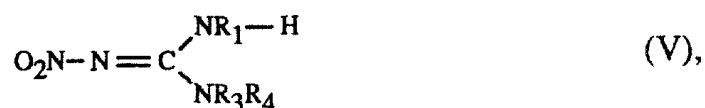


分子式中 R_1 , R_2 , R_3 , R_4 和 A 与分子式 I 中的具有相同意义, 或

b) 具有分子式 IV 的化合物

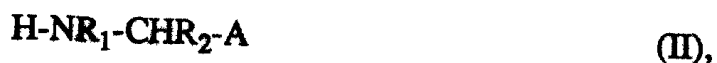


与具有分子式 V 的硝基胍衍生物在碱存在的条件下反应

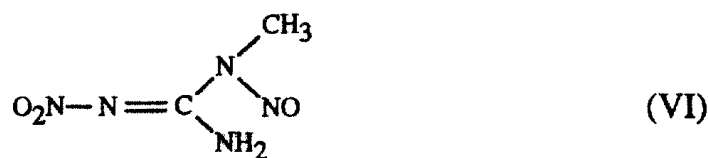


在此分子式中, R_1 , R_2 , R_3 , R_4 和 A 的定义与分子式 I 所给出的相同, H_{a1} 是卤素, 最好是氯或溴。

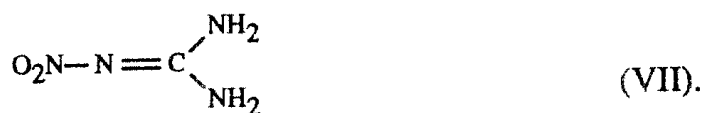
R_3 和 R_4 是氢的分子式 I 化合物也能由具有分子式 II 的胺



其中 R_1 , R_2 和 A 意义已由分子式 I 给出, 与分子式 VI 的化合物 1-甲基-1-亚硝基-2-硝基胍反应制得,

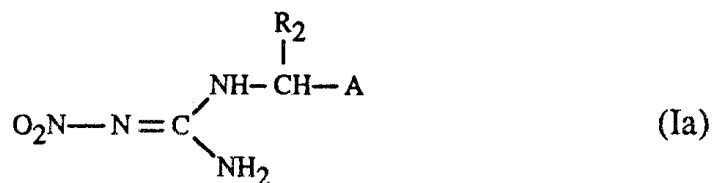


也可以与具有分子式 VII 的硝基胍反应制得,

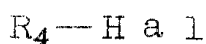
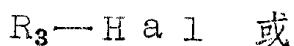
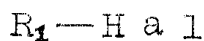


按照本发明, 反应过程 (II + III \rightarrow I) 的工艺方法 a) 最好是在惰性溶剂中、在 0 至 + 150 °C 的温度下进行, 尤其在 + 40 °C 至 120 °C。非常合适的溶剂是醇如甲醇, 乙醇或异丙醇。反应过程 b (IV + V \rightarrow I) 最好是在极性的惰性溶剂如乙腈和二甲基甲酰胺中进行, 温度是在 + 50 °C 到反应混合物的沸点之间。相适应的碱是碳酸盐如碳酸钾。氢化物如氢氧化钠也能作为碱使用。当在乙腈和二甲基甲酰胺中使用氢氧化钠时, 可以降低反应温度到 10 °C 至 25 °C, 并不会导致一相当长反应时间。II 与 VI 最好在含水及乙醇溶液中进行, 温度在 0 °C 和 25 °C 之间。在这个反应中, 生成付产物 N-亚硝基甲基胺。II 通常与 VII 在含水溶剂中反应, 温度在 + 40 °C 至 + 100 °C 之间, 最好在 + 60 °C 至 80 °C 之间。

R_1 , R_2 和 R_4 不是氮的分子式 I 胍衍生物, 可以由分子式 I a 的化合物来制备



式中 R_2 和 A 的定义同分子式 I 给出的相同，此反应是通过在一个碱存在下进行烷基化反应，使用的烷基化试剂有：



式中 R_1 ， R_3 和 R_4 如分子式 I 所给定的意义，它们不是氢， H a l 是卤素，最好是氯和溴。

由于已知上面类型的烷基化反应很难定位 (regiospecifically) 进行，这个烷基化步骤最适合于制备叔胺基团，即尤其适合于胍氮原子上所保持的三个氢同时被相同类型的 R_1 ， R_3 和 R_4 取代。

在另一方面，如果在所有情况下只需要引入一个取代基来代替一个氢原子，那么按上面的烷基化以简单的方式获得分子式 I 的胍衍生物，所有基团的 R_1 ， R_3 和 R_4 是非氢的。如果空间位阻非常大，如在胍结构上存在一些基团，如 $-\text{C H R}_2-\text{A}$ ，或者 R_1 ， R_3 或 R_4 都被引入，则这种类型的烷基化反应仍适用于制备仲胍氨基化合物。如果具有分子式 Ia 的化合物与一或二当量的烷基化试剂反应，产物将是不同

程度烷基化产物及异构体的混合物。然而使用一般的分离方法这些混合物能分离开，尤其可以选出所需的组分。

所提及的烷基化反应条件是温度在 0°C 到 $+150^{\circ}\text{C}$ 之间，最好是在 $+10^{\circ}\text{C}$ 到 $+50^{\circ}\text{C}$ 。适合的碱是碱金属氢化物和碱土金属氢化物，如氢化钠或氢化钙，以及碳酸盐，如碳酸钠或碳酸钾。这个烷基化反应最好在极性惰性溶剂中完成，如乙腈和二甲基甲酰胺。

分子式 II, III, IV, V, VI 和 VII 的中间体是已知的并可用与已知类似的方法制备。

现在已发现具有本发明分子式 I 的化合物对害虫控制是很有效的，而温血动物，鱼类，植物都对该化合物有很好的抗药能力。尤其本发明的一些活性物质的使用是与下列虫类相关的，如昆虫和蜘蛛纲动物，它们出现在农业中的庄稼上和装饰用植物上，尤其在棉花，蔬菜和水果种植园中，在森林里，在保管贮存的产品和物资中，在卫生区，尤其在家养的动物身上和多产的家畜身上。它们可以有效地防止所有的或某一成长阶段对其敏感但也有抗药能力的虫类。在这个意义上，它们的作用在下述方面是很明显的：直接杀死害虫，或仅在一定时间后起作用，例如在脱壳期间，或通过减少产卵量和孵化速度。上面所涉及到的害虫包括：

属于鳞翅目的有，例如，卷叶蛾类，小卷叶蛾类，透翅蛾类，地老虎类，亚拉巴马粘土虫 (*Alobama argillaceae*)，淀粉虫类 (*Amylois spp.*)，黎豆夜蛾，黄卷蛾类 (*Archips spp.*)，带卷蛾类，纹叶蛾类，玉米梢夜蛾，粉班螟，检小食心虫，禾螟类，卷叶蛾类 (*choristoneura spp.*)，葡萄果囊蛾，稻纵卷螟类，卷蛾类，细卷蛾类 (*cochyliis spp.*)，鞘蛾

类, 蛾 (*Crocidolomia binotalis*), 苹果异形小卷蛾, 小卷蛾类 (*Cydia* spp.), 螟类, 展叶松夜蛾, 金钢钻类, 粉螟类, 花小卷蛾类, 蛾 (*Eupoecilia ambiguella*), 毒蛾类, 切根虫类, 食心虫类, 广翅小卷蛾 (*Hedya nubiferana*), 夜蛾类 (*Heliothis* spp.), 菜螟, 美国白蛾, 番茄囊蛾, 旋纹潜叶蛾, 细蛾类, 小卷蛾 (*Lobesia botrana*), 毒蛾类, 潜蛾类, 天幕毛虫类, 甘蓝夜蛾, 烟草天蛾, 天蛾类, 欧洲玉米蛾, 超小卷蛾类, 褐卷蛾类, 小眼夜蛾, 红铃虫, 马铃薯块茎蛾, 菜青虫, 粉蝶类, 小菜蛾, 巢蛾类, 白螟类, 大螟类, 长须卷蛾类, 粘虫类, 透翅蛾类, 带蛾类 (*Thaumetopoea* spp.), 卷蛾类, 粉纹夜蛾和巢蛾类;

属于鞘翅目的有, 例如

甲类, 象甲类, 甜菜隐甲食, 甜菜胫跳甲蛀茎象甲类, 象甲类 (*Curculio* spp.) 皮囊类, 叶甲类, 象虫类, 荒漠群落类 (*Eremnus* spp.), 马铃薯甲虫, 象甲类, 鳃鱼金龟类, 象甲类, 耳喙象类, 金龟类, 跳甲类, 劫根囊类 (*Rhizopertha* spp.), 金龟 (*Scarabeidae*), 象类 (*Sitophilus* spp.), 蛾类, 甲类, 谷盗类和斑皮囊类; 属于直翅目的有, 例如啡蠊类, 小蠊类, 蝼蛄类, 马德拉蛭蠊, 飞蝗类, 大蠊类和啮蝗类。

属于等翅目的有, 例如白蚁类; 属于蛭目的有, 例如书虱类; 属于虱目的有, 例如盲虱类, 长颚虱类, 头虱类, 痒痒类和痒痒类; 属于食毛目的有, 例如 *Damalinea* spp. 和羽虱类;

属于缨翅目的有，例如蓟马类，棕榈蓟马，烟草蓟马，和非洲桔梗蓟马；

属于异翅亚目的有，例如臭虫类，可可瘤盲蝽；红蝽类，*Euchistus* spp.，褐盾蝽类，蛛缘蝽类，综蝽类，拟网蝽类，红腹猎蝽类，可可褐盲蝽，黑蝽类和吸血猎蝽类；

属于同翅亚目的有，例如

绵粉虱，芥粉虱，圆红蚧类，蚜科，蚜类，圆蚧类，棉粉虱，蜡蚧类 (*Ceroplaster* spp.)，茶褐圆蚧，蔷薇轮蚧，褐软蚧，微叶蝉，苹绵蚧，斑叶蝉，*Gascardia* spp.，飞虱类，李蜡蚧，蛴蚧类，长管蚧类，瘤额蚧类，叶蝉类，飞虱类，*Paratorla* spp.，缨绵蚧类，粉蚧类，蚧类，灰粉蚧类，木虱类，黑绵蚧，圆蚧类，管蚧类，蚧类，叶蝉类，叉蚧类，*Sitobion* spp.，温室白粉虱，*triozaerytreae*和桔盾蚧；

属于膜翅目的有，例如

Acromyrmex，切叶蚁类，茎蜂类，叶蜂类，松叶蜂科，云杉叶蜂，叶蜂类 (*Hoplocampa* spp.)，蚁类 (*Lasius* spp) 厨蚁，锯角叶蜂，火蚁类和胡蜂类；

属于双翅目的有，例如

伊蚊类，*Antherigona soccata*，花园毛蚊，红头丽蝇，实蝇类，金蝇类，库蚊类，痘蝇类，实蝇类，黄猩猩果蝇，厩蝇类，胃蝇类，舌蝇类，皮蝇类，潜蝇类，缘蝇类，潜蝇类 (*Melanagromyza*)，家蝇类，鼻蝇类，*Orseolia* spp.，瑞典蝇，菠菜潜叶蝇，麦蝇类，苹实蝇，尖眼蕈蚊类，蓟蝇类，牛虻类，*Tannia* sp. 和大蚊类；

属于蚤目的有，例如

毛列蚤类，东方鼠蚤，

属于蜱螨目的有，例如

粗脚粉螨，桔蚜瘿螨，苹刺瘿螨，花蜱螨，隐喙蜱类，方头蜱类，短须螨类，苜蓿苔螨，*Colipitimerus* spp.，痒螨类，鸡皮刺螨，长耳栉东方叶螨，瘿螨类，璃眼蜱类，硬蜱类，草地小瓜螨，喙蜱类，红蜘蛛类，桔镁螨，侧多食跗线螨，痒螨类，扇头蜱类，根螨类，蚧螨类，线螨类和红叶螨；属于缨尾目的有，例如西洋花鱼。

本发明式I化合物的好的杀虫剂作用相当于所提及害虫的死亡率至少为50—60%。

按照本发明的化合物和含有这些化合物的混合物通过加入其他的杀虫剂和杀螨剂能相当大地扩大其作用，并能适应特定的环境。例如下列类型的有效成分是比较合适的添加物的代表：有机磷化合物，硝基酚及衍生物，甲胺，尿素，氨基甲酸酯，拟除虫菊酯，氯代烃和苏云金杆菌(*Bacillus thuringiensis*)的制剂。

式I的化合物可以直接使用，更好的是加入本领域中常用的辅助剂，这样就可以一种常用的方式加工，以制成例如乳油，可直接喷雾的或可稀释的溶液，稀乳液，可湿性粉剂，可溶性粉剂，粉末，颗粒剂，也可以制成在聚合物中的胶囊剂。应用方法是选择喷雾还是选择喷撒，撒粉或浇泼，以及不同的组合，要适应自己的目的和主要条件。式I的化合物还适用于种子处理，这时可以用这种有效成分或含有此有效成分的一种配方剂在播种以前处理或包衣(dressed)种子，或者在播种时将此有效成分撒入播种子的车沟中。

配制剂，即，含有式 I 有效成分的组合、制剂、或这些活性成分与其它杀虫剂或杀螨剂形成的组合，如果需要的话，还包括固体或液体添加剂，是采用已知的方法制备的，如，将有效成分与溶剂、固体载体、如需要的话，及表面活性化合物（表面活性剂）之类的填充剂一起充分地混合和/或研磨。

下列物质适于用作溶剂：芳烃，最好是 8—12 碳的烷基苯，如二甲苯混合物或烷基萘，链烷或环烷烃类，如环己烷，链烷（paraffins）或四氢化奈，醇类如乙醇，丙醇或丁醇，和乙二醇及其醚和酯如丙二醇，二丙基乙二醚，乙二醚，乙二醚单甲醚或乙二醚单乙醚，酮类如环乙酮，异佛尔酮或乙二酮，强极性溶剂如 N-甲基-2-吡咯烷酮，二甲亚砷或二甲基甲酰胺，或水，植物油如油菜子油、蓖麻油，椰子油或豆油；硅油也可。

固体类载体，例如常用来作为粉剂和可分散的粉剂的，是研碎的自然矿物，如方解石，滑石，高岭土，蒙脱土或凹凸棒石。为改善其物理特性，也可加入高分散硅石或高分散吸水性聚合物。用于粒剂的适宜的颗粒、吸附载体是多孔性的，例如浮石，块状石英砂（brick grit），海泡石或皂土，也可以是非吸附性载体，例如方解石或砂子。而且大量无机或有机天然粒状物都可使用，例如尤其是大理石或粉碎的植物残渣。

合适的表面活性物质是非离子型的，阳离子型的和/或阴离子型的表面活性剂，它要具有良好的乳化，分散和浸润性，这取决于具有分子式 I 的有效成分的原先特性或这些有效成分与其它杀虫剂或杀螨剂的混合物的性质。这里所说的表面活性剂也应理解成为表面活性剂的混合物。

合适的阴离子型表面活性剂可以是所谓的水溶性皂类或水溶性合成表面活性物质。

合适的皂类是大分子脂肪酸 (C₁₀—C₂₂) 的碱金属盐, 碱土金属盐或取代或未取代的铵盐, 如油酸或硬脂醇的钠盐或钾盐, 或能从例如椰子或动物脂油得到的脂肪酸的天然混合物的钠盐或钾盐, 脂肪酸甲基氨基乙磺酸酯 (fatty acid methyltaurinate) 也可作为表面活性剂。

但是, 所谓合成表面活性剂使用得更多, 特别是脂肪磺酸盐, 脂肪硫酸盐, 磺化的苯并咪唑衍生物或烷芳基磺酸盐。

脂肪磺酸盐或脂肪硫酸盐一般是碱金属盐, 碱土金属盐或取代或非取代的铵盐, 并且一般含有一个 8—22 碳原子的烷基, 这里的烷基也包括酰基的烷基部分, 例如从天然脂肪酸制备的木质素磺酸, 十二烷基磺酸酯或脂肪醇硫酸醇的钠盐或钙盐的混合物。这种组合物中也包括脂肪醇/环氧乙烷加合物的硫酸酯和磺酸的盐类。磺化的苯并咪唑衍生物最好含有 2 个磺酰基和一个约 8—22 碳的脂肪烷基。例如烷芳基磺酸盐是十二烷基苯基磺酸, 二丁基萘基磺酸或奈基磺酸/甲醛缩合物的钠、钙或三乙醇胺的盐。其它合适的化合物是相应的磷酸盐, 如对-壬苯酚/(4-14)-环氧乙烷加合物的磷酸酯的盐, 或磷脂。

合适的非离子型表面活性剂主要是脂肪醇或环脂醇, 饱和或未饱和的脂肪酸和烷基苯酚的聚乙二醇醚衍生物, 它含有 3—30 个乙二醇醚基团并在脂肪 烃基中有 8—20 碳原子, 烷基苯酚的烷基中含有 6—18 个碳原子。其它合适的非离子型表面活性剂是水溶性聚环氧乙烷与聚丙二醇, 乙二胺聚丙二醇和烷基聚丙二醇的加合物。其中的烷基链有 1—10 个碳原子和 20—250 个乙二醇醚基和 10—

100个丙二醇醚基。上述化合物中每个丙二醇单元通常含有1—5个乙二醇单元。

值得一提的非离子型表面活性剂还包括：

壬基苯酚聚乙氧基乙醇，蓖麻油聚乙二醇醚，聚丙烯/聚环氧乙烯加合物，三丁基苯氧基聚乙氧基乙醇，聚乙二醇和辛基苯氧基聚乙氧基乙醇。其它合适的物质有聚氧 乙烯山梨糖醇酐的脂肪酸酯，如聚氧 乙烯山梨糖醇酐三油酸酯，

阳离子型表面活性剂主要是季铵盐，其中包括至少一个N—取代的8—22碳烷基和低级卤化的或未卤化的烷基，苯基或低级羟烷基作为进一步的取代基团。盐最好是卤化物，硫酸甲酯或硫酸乙酯的形式，例如硬脂酰三甲铵基氯化物或苜基二(2—氯乙基)—乙基铵溴化物。

常用的表面活性剂在配方文献中有描述，例如可见于下列出版物中：

Mc Cutcheon, “清洗剂 and 乳化剂年报”, Mc 出版公司, Glen Rock, NJ, 美国, 1988.

H. Stache, “Tensid — Taschenbuch (表面活性剂指南)”, 第二版, C. Hanser Verlag Munich, 维也纳 1981.

M. 和 J. Ash. “表面活性剂大全”, I—III卷, 化学出版公司, 纽约, 1980—1981.

一般, 制备的杀虫剂含有0.1—99%, 尤其是0.1—95%的分子式I的有效成分或此有效成分与其它杀虫剂或杀煤剂的混合

物，1—99.9%的固体或液体添加物和0—25%，尤其是0.1—25%的表面活性剂。虽然浓缩组分经常是更适于作为商品，但最后的使用者通常使用含有效成分很低的稀释制品。典型的使用的含量是0.1—1,000 ppm之间，最好0.1—500 ppm。每公顷的用量一般是每公顷1—1,000 g有效成分，最好是25—500 g/公顷。

特别地，优选的配方具有下列成分：

(% = 重量百分数)

乳油：

有效组分： 1—90%，最好5—20%
表面活性剂： 1—30%，最好10—20%
液态载体： 5—94%，最好70—85%

粉剂：

有效组分： 0.1—10%，最好0.1—1%
固态载体： 99.9—90%，最好99.9—99%

浓悬液：

有效组分： 5—75%，最好10—50%
水： 94—24%，最好88—30%
表面活性剂： 1—40%，最好2—30%

可湿性粉剂：

有效组分： 0.5—90%，最好1—80%

表面活性剂： 0.5—20%，最好1—15%

固态载体： 5—95%，最好15—90%

粒剂：

有效组分： 0.5—30%，最好3—15%

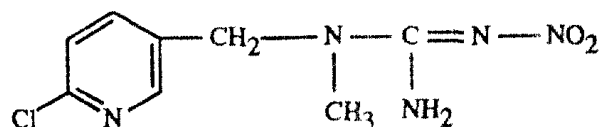
固态载体： 99.5—70%，最好97—85%

上述组分中还可含有其它添加剂如稳定剂，例如环氧化或未环氧化植物油（环氧化的椰子油，油菜子油或蓖麻油），消泡剂，例如硅油，防腐剂，粘度调节剂，粘结剂，增粘剂和化肥及其它的有效成分，以便取得特定的效果。

下面用实例来进一步说明本发明。但不限制本发明。

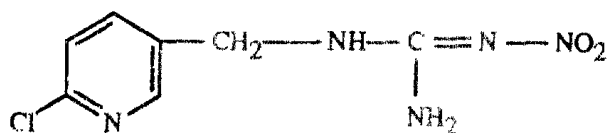
制备实施例

实施例H 1： 1—（2—氯吡啶—5—基甲基）—1—甲基—2—硝基胍



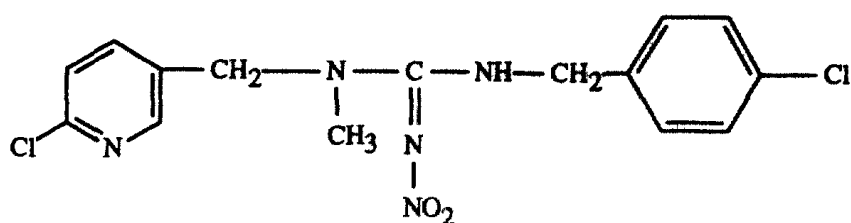
3.2 g N-甲基(2-氯吡啶-5-基)甲胺, 2.7 g S-甲基-N-硝基异硫脲, 0.2 g 硫酸氢钾和75 ml 乙醇一起回流4.5小时。热过滤反应混合物。当滤液冷却到0℃, 粗产物结晶。从乙醇中重结晶可以得到纯的1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-1-甲基-2-硝基胍, 它是熔点163-165℃的无色晶体。

实施例H 2: 1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-2-硝基胍



4.0 g 硝基胍和 5.4 g (2-氯吡啶-5-基)甲胺在80 ml 水中形成的悬浮液在+80℃加热3小时。当反应混合物冷却到+20℃, 产物沉淀16小时得到无色晶体。分离出的晶体用甲醇洗涤并干燥。这样得到2.0 g 1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-2-硝基胍, 熔点195-197℃。

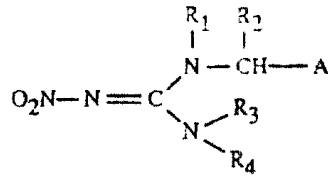
实施例H 3: 1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-2-(4-氯苄基)-1-甲基-3-硝基胍



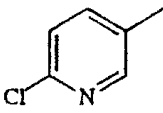
向在 50 ml 二甲基甲酰胺中含有 4.0 g 1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-1-甲基-2-硝基胍的溶液于 10-15°C 分次加入 0.7 g 的 55% 氯化钠。20 分钟后，在 10-15°C 滴加 5 ml 二甲基甲酰胺中含有 2.65 g 4-氯代苄基氯化物的溶液。反应混合物在室温下搅拌 20 小时，之后倒入 200 ml 冰水中。水溶液再用氯仿萃取。分离出有机相，干燥，蒸发。用硅胶柱色谱分离纯化得到 1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-2-(4-氯苄基)-1-甲基-3-硝基胍，熔点 130-132°C。

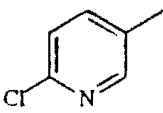
下表中所列分子式 1 的化合物可以用类似方法制备。

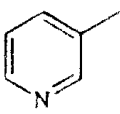
表 1

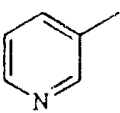


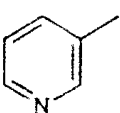
化合物 序号	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	物理常数
-----------	---	----------------	----------------	----------------	----------------	------

1.01		CH ₃	H	H	H	熔点 163-165°C
------	---	-----------------	---	---	---	--------------

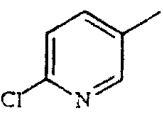
1.02		H	H	H	H	" 195-197°C
------	--	---	---	---	---	-------------

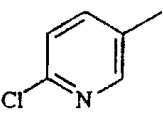
1.03		H	H	CH ₃	H	" 162-163°C
------	---	---	---	-----------------	---	-------------

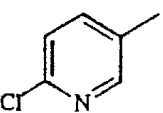
1.04		CH ₃	H	H	H	" 134-136°C
------	---	-----------------	---	---	---	-------------

1.05		CH ₃	H	CH ₃	H	
------	---	-----------------	---	-----------------	---	--

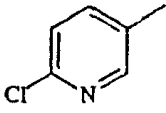

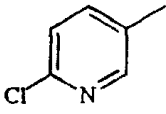
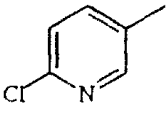
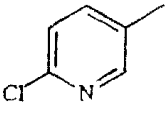
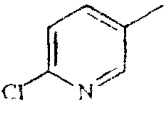
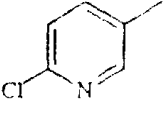
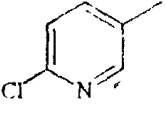
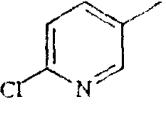
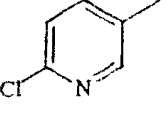
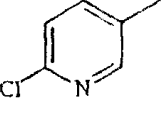
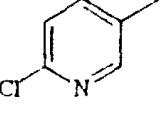
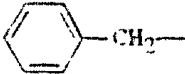
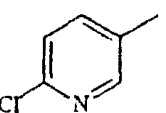
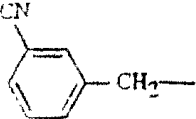
树脂, ¹H-NMR (CDCl₃):
 2.96 (s, 3H),
 3.04 (s, 3H),
 4.70 (s, 2H),
 8.10 (宽 s, 1H)

1.06		CH ₃	H	CH ₃	H	熔点 129-131°C
------	---	-----------------	---	-----------------	---	--------------

1.07		H	H	C ₂ H ₅	H	" 125-127°C
------	---	---	---	-------------------------------	---	-------------

1.08		H	H	C ₃ H _{7-n}	H	
------	---	---	---	---------------------------------	---	--

化合物
序号

	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	物理常数
09		H	H		H	
1.10		H	H	C ₃ H _{7-i}	H	
1.11		H	H	C ₄ H _{9-n}	H	熔点 88-90°C
1.12		H	H	C ₄ H _{9-s}	H	
1.14		H	H	CH ₃	CH ₃	熔点 158-160°C
1.15		H	H	CH ₃	C ₂ H ₅	" 115-119°C
1.16		H	H	CH ₃	C ₆ H _{9-n}	
1.17		H	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	树脂
1.18		H	H	C ₄ H _{9-n}	C ₄ H _{9-n}	
1.19		H	H	CH ₂ CH ₂ -CH ₂ CH ₂ -		
1.20		H	H	H		熔点 154-155°C
1.21		H	H	H		

化合物
序号

A

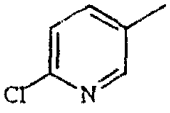
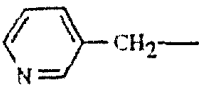
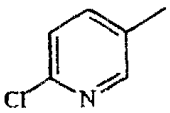
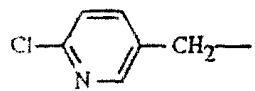
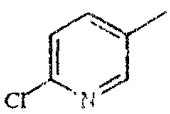
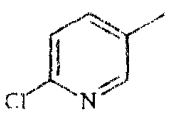

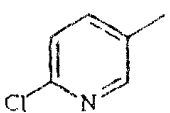
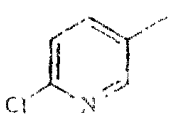
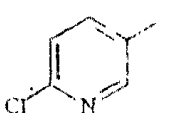

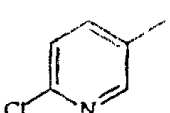
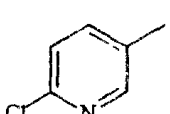
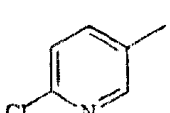

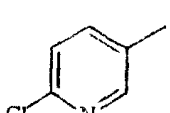
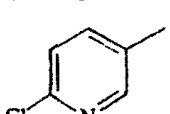
R₁

R₂

R₃

R₄

物理常数

1.22		H	H	H		
1.23		H	H	H		
1.24		C ₂ H ₅	H	H	H	熔点 136-138°C
1.25			H	H	H	
1.26		C ₃ H _{7-n}	H	H	H	
1.27		C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	熔点 107-109°C
1.28			H	CH ₃	H	
1.29		CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	
1.30		C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	
1.31			H	C ₂ H ₅	H	
1.32		CH ₃	H	C ₃ H _{7-n}	H	
1.33		C ₂ H ₅	H	C ₃ H _{7-n}	H	

化合物
序号

A

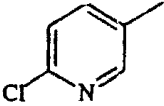

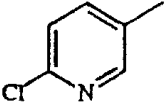

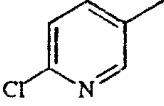
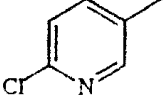

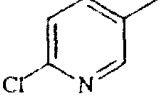
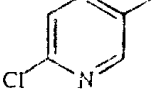
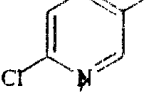
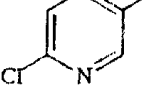
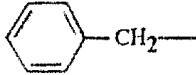
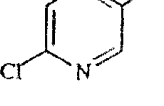
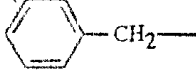
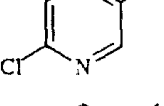
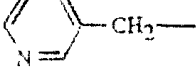
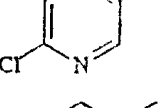
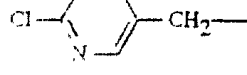
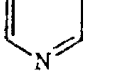
R₁

R₂

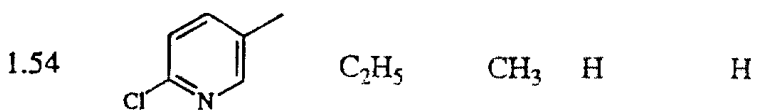
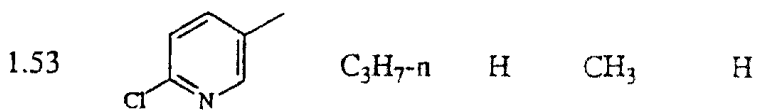
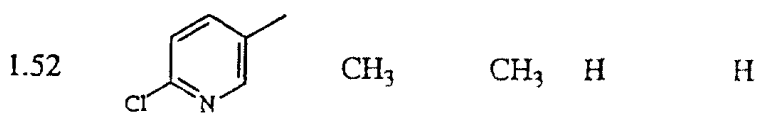
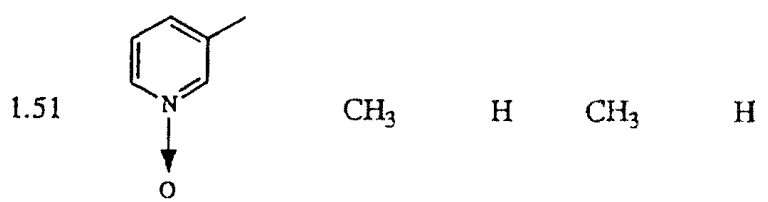
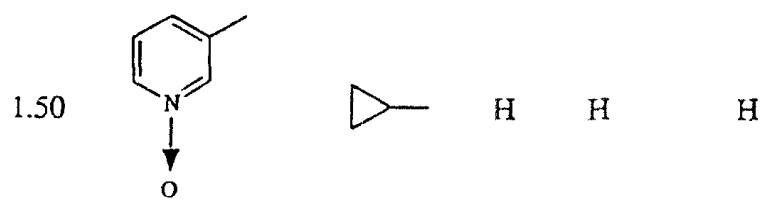
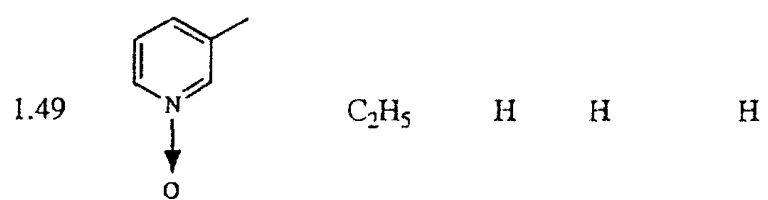
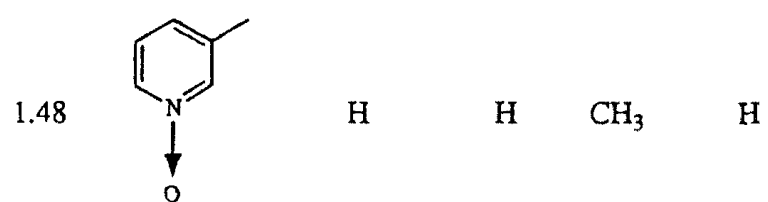
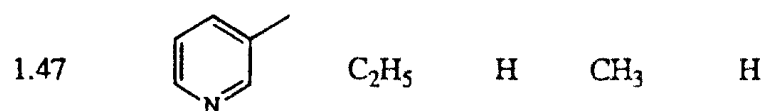
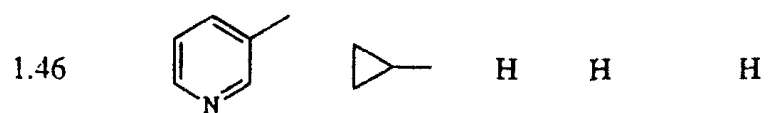
R₃

R₄

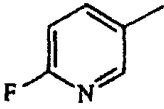
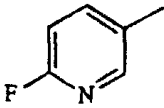
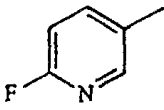
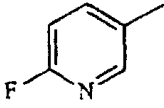

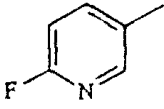
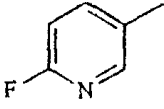
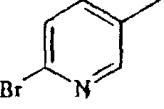
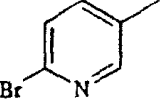
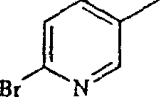
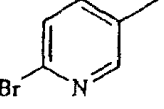
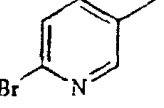
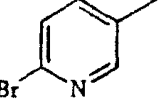

物理常数

1.34		CH ₃	H		H
1.35		C ₂ H ₅	H		H
1.36		CH ₃	H	C ₃ H _{7-i}	H
1.37			H	C ₃ H _{7-i}	H
1.38		CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
1.39		C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃
1.40		CH ₃	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
1.41		H	H	CH ₃	
1.42		CH ₃	H	H	
1.43		CH ₃	H	H	
1.44		CH ₃	H	H	
1.45		C ₂ H ₅	H	H	H

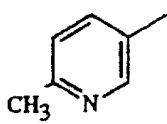
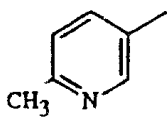
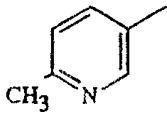
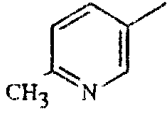
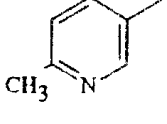
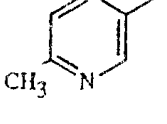

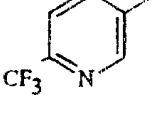
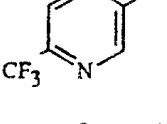
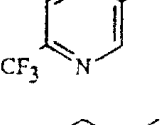
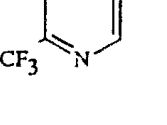
化合物 序号	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	物理常数
-----------	---	----------------	----------------	----------------	----------------	------

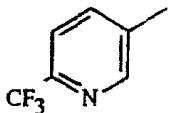
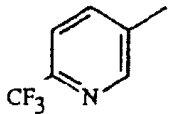

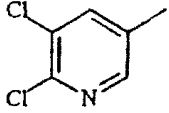
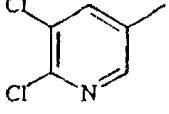
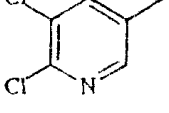
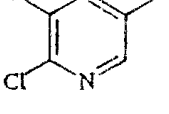
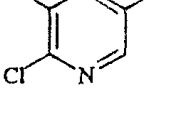
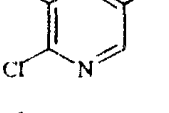

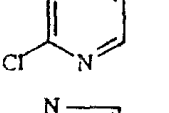

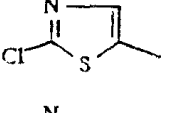
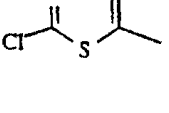


化合物 序号	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	物理常数
-----------	---	----------------	----------------	----------------	----------------	------

1.55		CH ₃	H	H	H	
1.56		CH ₃	H	CH ₃	H	
1.57		H	H	CH ₃	CH ₃	
1.58			H	H	H	
1.59		C ₂ H ₅	H	H	H	
1.60		C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	
1.61		CH ₃	H	H	H	
1.62		CH ₃	H	CH ₃	H	
1.63		C ₂ H ₅	H	H	H	
1.64		C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	
1.65		H	H	CH ₃	CH ₃	
1.66			H	CH ₃	H	

化合物 序号	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	物理常数
-----------	---	----------------	----------------	----------------	----------------	------

1.67		CH ₃	H	H	H	
1.68		CH ₃	H	CH ₃	H	
1.69		C ₂ H ₅	H	H	H	
1.70		C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	
1.71		H	H	CH ₃	CH ₃	
1.72			H	CH ₃	H	
1.73		CH ₃	H	H	H	
1.74		CH ₃	H	CH ₃	H	
1.75		C ₂ H ₅	H	H	H	
1.76		C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	

化合物 序号	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	物理常数
1.77		H	H	CH ₃	CH ₃	
1.78			H	H	H	
1.79		CH ₃	H	H	H	
1.80		CH ₃	H	CH ₃	H	
1.81		C ₂ H ₅	H	H	H	
1.82		C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	
1.83		H	H	CH ₃	CH ₃	
1.84			H	H	H	
1.85			H	CH ₃	H	
1.86		CH ₃	H	H	H	熔点 112—114 °C
1.87		CH ₃	H	CH ₃	H	

化合物
序号

A

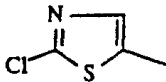
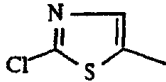
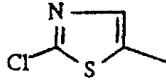
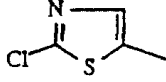
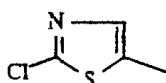
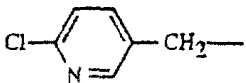
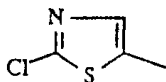
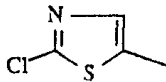

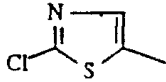

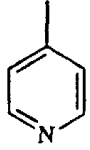
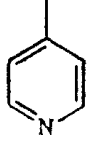
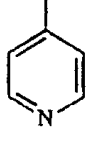

R₁

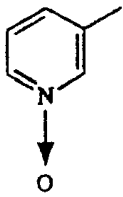
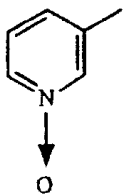
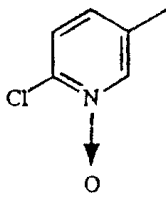
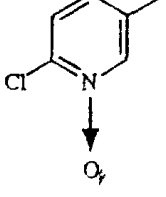
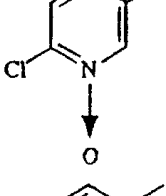
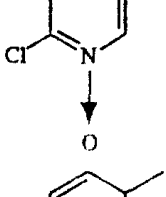

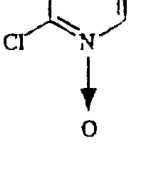
R₂

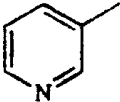
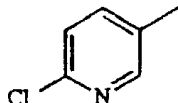
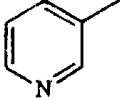
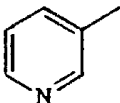
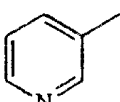
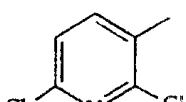
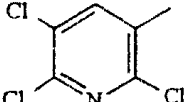
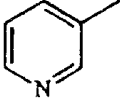
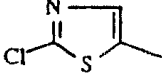
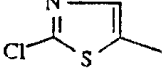
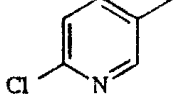

R₃

R₄

物理常数

1.88		C ₂ H ₅	H	H	H	
1.89		C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	
1.90		C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	
1.91		H	H	CH ₃	CH ₃	熔点 159-160°C
1.92		H	H	CH ₃		
1.93		H	H	CH ₃	H	熔点 168-170°C
1.94			H	H	H	
1.95			H	CH ₃	H	
1.96		CH ₃	H	H	H	
1.97		CH ₃	H	CH ₃	H	
1.98			H	H	H	

化合物 序号	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	物理常数
1.99		CH ₃	H	H	H	熔点 203-205°C
1.100		H	H	CH ₃	CH ₃	
1.101		H	H	CH ₃	CH ₃	
1.102		CH ₃	H	CH ₃	H	
1.103		C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	
1.104			H	CH ₃	H	
1.105		CH ₃	H	H	H	熔点 198-200°C

化合物 序号	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	物理常数
1.106		H	H	H	H	熔点.201-202°C
1.107		H	H	CH ₃	H	" 148-150°C
1.108		H	H	CH ₃	CH ₃	" .145-146°C
1.109		H	H	C ₂ H ₅	H	" 113-116°C
1.110		H	CH ₃	H	H	" 158-160°C
1.111		CH ₃	H	H	H	" 210-212°C
1.112		CH ₃	H	H	H	" 202-203°C
1.113		H	CH ₃	CH ₃	H	" 161-163°C
1.114		H	H	H	H	" 158-160°C
1.115		H	H	C ₂ H ₅	H	" 135-136°C
1.116			CH ₃	H	H	

化合物
序号

A

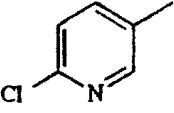
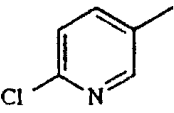
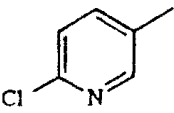

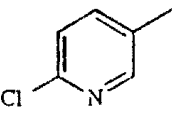
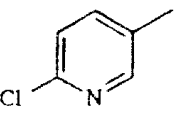
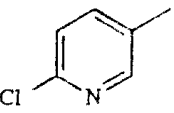
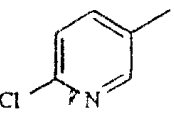

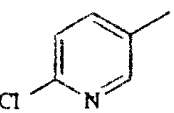
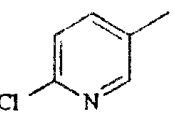
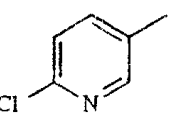
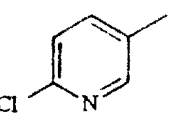
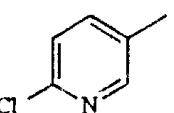
R₁

R₂

R₃

R₄

物理常数

1.117		CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
1.118		CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H
1.119		CH ₃	CH ₃		H
1.120		CH ₃	CH ₃	C ₃ H _{7-n}	H
1.121		H	CH ₃	CH ₃	H
1.122		H	CH ₃	C ₂ H ₅	H
1.123		H	CH ₃		H
1.124		H	CH ₃	C ₃ H _{7-n}	H
1.125		H	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
1.126		H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
1.127		H	C ₂ H ₅	CH ₃	H
1.128		H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H

化合物
序号

A

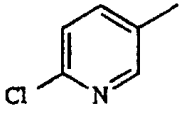
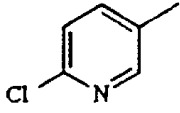
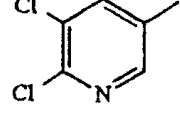
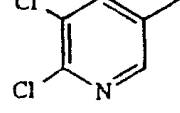
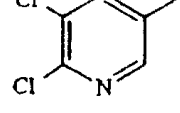

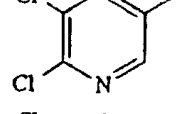
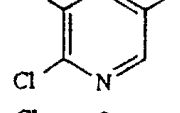
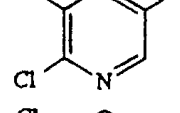
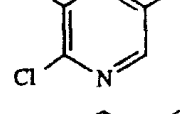
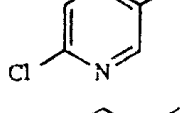
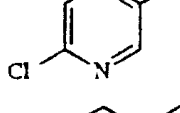
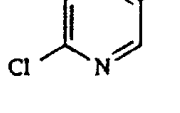
R₁

R₂

R₃

R₄

物理常数

1.129		CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	
1.130		CH ₂	C ₂ H ₅	CH ₃	H	
1.131		H	H	CH ₃	H	熔点 173-175°C
1.132		H	H	C ₂ H ₅	H	" 159-161°C
1.133		H	H		H	
1.134		H	H	C ₃ H _{7-n}	H	
1.135		H	H	CH ₃	C ₂ H ₅	
1.136		CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	
1.137		CH ₃	H	C ₃ H _{7-n}	H	
1.138		H	H	-(CH ₂) ₄ -		
1.139		H	H	-(CH ₂) ₅ -		
1.140		H	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -		

化合物
序号

A

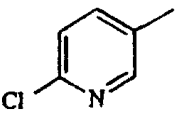
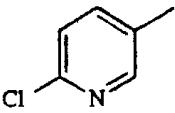
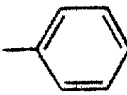
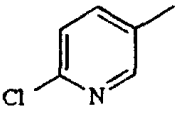
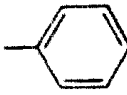
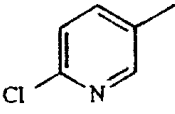

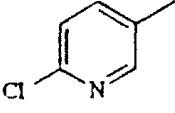

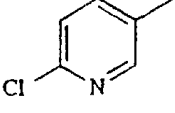

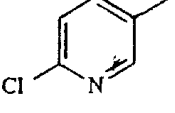
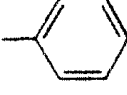
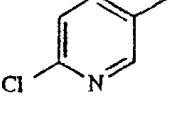
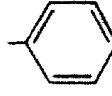
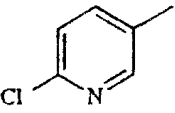
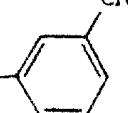
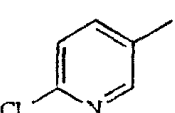
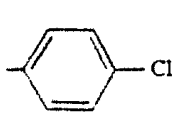
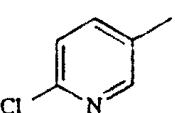
R₁

R₂

R₃

R₄

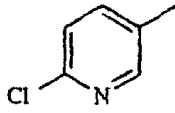
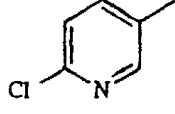
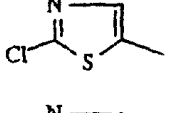
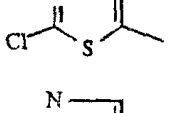
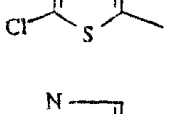
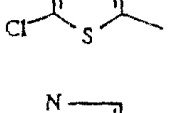
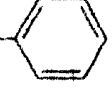
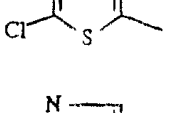
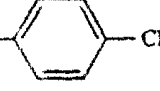
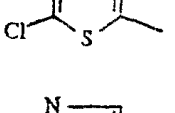
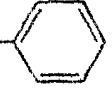
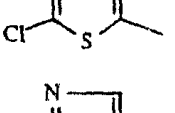
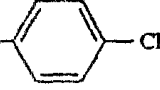
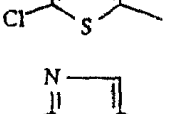
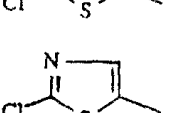

物理常数

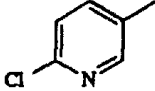
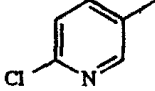
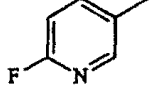
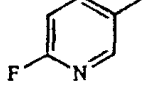
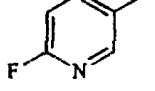
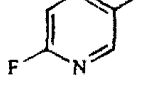
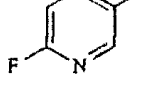
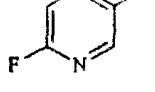
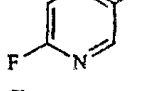
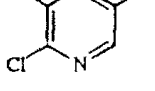
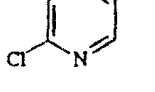
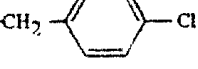
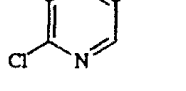
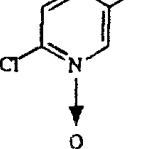
1.141		H	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
1.142		H	H		H
1.143		CH ₃	H		H
1.144		H	H		H
1.145		CH ₃	H		H
1.146		C ₂ H ₅	H		H
1.147		C ₂ H ₅	H		H
1.148		H	CH ₃	H	-CH ₂ - 
1.149		H	CH ₃	H	-CH ₂ - 
1.150		H	CH ₃	H	-CH ₂ - 
1.151		C ₃ H _{7-n}	H	H	H

化合物
序号

A R₁ R₂ R₃ R₄

物理常数

1.152		C ₃ H _{7-n}	H	CH ₃	H
1.153		C ₃ H _{7-n}	H	C ₂ H ₅	H
1.154		C ₃ H _{7-n}	H	H	H
1.155		C ₃ H _{7-n}	H	CH ₃	H
1.156		C ₃ H _{7-n}	H	C ₂ H ₅	H
1.157		H	H	H	-CH ₂ - 
1.158		H	H	H	-CH ₂ - 
1.159		CH ₃	H	H	-CH ₂ - 
1.160		CH ₃	H	H	-CH ₂ - 
1.161		C ₃ H _{7-i}	H	H	H
1.162		C ₁ H _{7-i}	H	CH ₃	H
1.163		C ₃ H _{7-i}	H	C ₂ H ₅	H

化合物 序号	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	物理常数
1.164		C ₃ H ₇ -i	H	CH ₃	H	
1.165		C ₃ H ₇ -i	H	C ₂ H ₅	H	
1.166		CH ₃	H	H	H	
1.167		C ₂ H ₅	H	H	H	
1.168		H	H	CH ₃	H	
1.169		H	H	C ₂ H ₅	H	
1.170		H	H	CH ₃	CH ₃	
1.171		H	H	CH ₃	C ₂ H ₅	
1.172		CH ₃	H	CH ₃	H	
1.173		H	H	H	H	熔点:207-209°C
1.174		CH ₃	H	H		" 130-132°C
1.175		H	H	C ₄ H ₉ -n	H	" 152-153°C
1.176		H	H	CH ₃	H	

配方实施例 (% = 重量百分数)

实施例 F 1: 乳油	a)	b)	c)
有效成分序号 1.0 5	2 5 %	4 0 %	5 0 %
十二烷基苯磺酸钙	5 %	8 %	6 %
蓖麻油聚乙二醇醚 (3 6 mol 的 EO)	5 %	—	—
三丁基苯酚聚乙二醇醚 (3 0 mol 的 EO)	—	1 2 %	4 %
环己酮	—	1 5 %	2 0 %
二甲苯混合物	6 5 %	2 5 %	2 0 %

在上述乳油中加水稀释可以配成任何适宜浓度的乳油液。

实施例 F 2: 溶液	a)	b)	c)	d)
有效成分序号 1.0 5	8 0 %	1 0 %	5 %	9 5 %
乙二醇单甲醚	2 0 %	—	—	—
聚乙二醇 M W 4 0 0	—	7 0 %	—	—
N-甲基-2-吡咯烷 酮	—	2 0 %	—	—
环氧化的椰子油	—	—	1 %	5 %
石油醚 (沸点范围 1 6 0 — 1 9 0 °C)	—	—	9 4 %	—

上述溶液适于以很小的液滴形式使用。

实施例 F 3: 颗粒	a)	b)	c)	d)
有效成分序号 1. 0 5	5 %	1 0 %	8 %	2 1 %
高岭土	9 4 %	—	7 9 %	5 4 %
高分散二氧化硅	1 %	—	1 3 %	7 %
凹凸棒石	—	9 0 %	—	1 8 %

有效成分溶解在二氯甲烷中，将此溶液喷在载体上，减压蒸发除去溶剂。

实施例 F 4: 粉剂	a)	b)
有效成分序号 1. 0 5	2 %	5 %
高分散二氧化硅	1 %	5 %
滑石	9 7 %	—
高岭土	—	9 0 %

将载体与有效成分充分混合后就可获得直接应用的粉剂。

实施例 F 5: 可湿性粒剂	a)	b)	c)
有效成分序号 1. 0 1 或 1. 0 3	2 5 %	5 0 %	7 5 %
木质素磺酸钠	5 %	5 %	—
十二烷基硫酸钠	3 %	—	5 %
二异丁基萘磺酸钠	—	6 %	1 0 %
辛基酚聚乙二醇醚 (7—8 mol 的 EO)	—	2 %	—

高分散二氧化硅	5%	10%	10%
高岭土	62%	27%	—

有效成分或其混合物与添加剂混合，混合物要在研磨机中充分研磨。这样可得到可湿性粉剂，这种剂能够用水稀释得到任何适当浓度的悬浮液。

实施例 F 6：乳油

有效成分序号 1. 0 1 或 1. 0 3	10%
辛基酚聚乙二醇醚 (4—5 mol 的 EO)	3%
十二烷基苯磺酸钙	3%
蓖麻油聚乙二醇醚 (3.6 mol 的 EO)	4%
环己酮	30%
二甲苯混合物	50%

用水稀释上述溶液即可得到任何浓度的乳状液。

实施例 F 7：粉剂

	a)	b)
有效成分序号 1. 0 2	5%	8%
滑石	95%	—
高岭土	—	92%

将有效成分与载体混合并在研磨机中研磨此混合物即得到可直接使用的粉剂。

实施例 F 8： 挤压粒剂

有效成分序号 1. 0 6	1 0 %
木质素磺酸钠	2 %
羧甲基纤维素	1 %
高岭土	8 7 %

有效成分或其混合物与添加剂混合，研磨此混合物并用水湿润。将混合物挤压，成粒状，再在空气中干燥。

实施例 F 9： 涂衣粒剂

有效成分序号 1. 0 4	3 %
聚乙二醇 (M W 2 0 0)	3 %
高岭土	9 4 %

在混合器中，充分研磨的有效成分或其混合物均匀涂覆到用聚乙二醇润湿的高岭土上。这样就得到无粉末的涂衣粒剂。

实施例 F 1 0： 浓悬液

有效成分序号 1. 0 1	4 0 %
乙二醇	1 0 %
壬基苯酚聚乙二醇醚 (1 5 m c l E O)	6 %

木质素磺酸钠	10%
羧甲基纤维素	1%
75%硅油的水乳状液	1%
水	32%

充分研磨的有效成分或其混合物与添加剂充分混合。这样得到的浓悬液可用水稀释而配成任何适宜浓度的悬浮液。

生物实施例

实施例 B 1：抗褐稻虱

谷类作物进行喷雾处理，此溶液是由水溶性乳状液制备的，其中含有效成分 400 ppm。喷上的覆盖层干了之后，将第 2 及第 3 阶段的蝉幼虫移植在此作物上。21 天后进行评价。昆虫总量减少百分数（% 作用）通过比较处理过和未处理过的作物上残存的蝉量得到。

在这项试验中，表 1 中的化合物抗褐稻虱效果好。尤其，使用化合物的序号为 1.01, 1.03, 1.04, 1.05, 1.07, 1.14, 1.15, 1.24, 1.86, 1.93, 1.107, 1.108, 1.113 和 1.115 时，作用率在 80% 以上。

实施例 B 2：抗黑尾叶蝉的作用

对谷类作物进行喷雾处理，此溶液是由水溶性乳状液制备的，其中含有效成分 400 ppm。喷上的覆盖层干了之后，将第 2 和第 3 阶段的蝉幼虫移植在此作物上。21 天后进行评价。总量减少百分数

(%作用)由比较处理过和未处理过的作物上存活蜂量得到。

在这项试验中，表1中的化合物对抗黑尾叶蜂的效果好。尤其在使用化合物的序号为1.01, 1.06, 1.14, 1.15, 1.19时作用率在80%以上。

实施例B3：抗黄瓜条叶甲幼虫的作用

对玉米籽苗进行喷雾处理，此溶液是由水溶性乳状液制备的，其中含有效成分400 ppm。喷上的覆盖层干了之后，将第二阶段的10个黄瓜条叶甲幼虫移植在玉米苗上。并放入塑料容器中。6天后进行评价。昆虫减少的百分数(%作用)由比较处理过和未处理过的作物上死去幼虫数量来确定。

在这项测验中，表1中的化合物抗黄瓜条叶甲的作用良好。尤其在使用化合物1.01时，作用率大于80%。

实施例B4：抗美洲菸夜蛾作用

新长出的大豆作物进行喷雾处理，此溶液由水溶性乳状液制备，其中含有效成分400 ppm。喷上的覆盖层干了之后，将第一阶段的10个美洲菸夜蛾移植到大豆株苗上，并放入塑料容器中。6天后评价。昆虫减少的百分数(%作用)由比较处理过和未处理过的作物上死去幼虫数量来确定。

在这项测验中，表1中的化合物抗美洲菸夜蛾的作用良好。尤其在使用化合物1.01, 1.07和1.110时，作用率大于80%。

实施例 B 5：抗滨水类夜蛾蠋作用

新长出的大豆作物进行喷雾处理，所用溶液由水溶性乳状液制备，其中含有效成分 400 ppm。待喷上的覆盖层干了之后，将 10 个第三阶段的滨水夜蛾蠋移植到大豆植物上并放入塑料容器中。3 天后评价。害虫减少百分数，或进食 (feeding) 破坏减少百分数 (% 作用)，由比较经处理过和未处理植物上死亡蠋量和进食破坏量来确定。

在这项测验中，表 1 中的化合物抗滨水类夜蛾的作用良好。尤其在使用化合物 1.01, 1.03, 1.07, 1.14, 1.86, 1.107 和 1.108 时，作用率大于 80%。

实施例 B 6：抗豆蚜作用

使豌豆苗感染上豆蚜，再用含有效成分 400 ppm 的喷雾液体进行喷雾并在 20°C 下培育。在 3 天和 6 天进行评价。害虫减少百分数由比较处理过和未处理植物上豆蚜死亡数量确定。

在这项测验中，表 1 的化合物抗豆蚜作用良好。尤其在使用化合物 1.01, 1.03, 1.04, 1.05, 1.06, 1.07, 1.14, 1.15, 1.24, 1.86, 1.91, 1.93, 1.99, 1.107, 1.114 和 1.115 时作用率大于 80%。

实施例 B 7：抗褐稻虱的内吸作用

将装有稻子植物的容器放在含有 400 ppm 有效成分的水溶性乳状液溶液中。再将第 2 和第 3 阶段的幼虫移植稻植物上。6 天后

评价。总量减少百分数（%作用）由比较处理过和未处理过植物上蝉的数量确定。

在这项测验中，表1化合物的抗褐稻虱作用良好。尤其在使用化合物 1.01, 1.03, 1.04, 1.06, 1.07, 1.14, 1.15, 1.86, 1.93, 1.107, 1.114 和 1.115 时，作用率大于 80%。

实施例 B 8：抗黑尾叶蝉的内吸作用

将装有稻子植物的容器放在含有 400 ppm 有效成分的水溶性乳状液溶液中。再将第 2 和第 3 阶段的幼虫移植在稻子植物上。6 天后评价。总量减少百分数（%作用）由比较处理过和未处理过植物上蝉的数量确定。

在这项测验中，表1化合物的抗黑尾叶蝉作用良好。尤其在使用化合物 1.01, 1.03, 1.04, 1.06, 1.14, 1.15, 1.86, 1.91 和 1.114 时，作用率大于 80%

实施例 B 9：抗桃蚜的内吸作用

使豌豆苗染上桃蚜，将其根部浸入含 400 ppm 有效成分的喷雾液中，此植物在 20℃ 下培育。3 天和 6 天评价。总量减少百分数（%作用）由比较处理过和未处理过植物上死亡蚜虫量来确定。

在这项测验中，表1化合物抗桃蚜性能变好。尤其是化合物 1.01, 1.06, 1.14 和 1.86 的作用率大于 80%。

实施例 B 10：抗棉铃象甲成虫作用

新长出的棉花植物用由水溶性乳状液制备含400ppm有效成分的喷雾液进行喷雾。喷上的覆盖层干了之后，将10只成虫棉铃象甲移植在棉花植物上，并放在塑料容器中。3天后评价。总量减少百分数，或进食破坏减少百分数（%作用），由比较处理过和未处理过植物的破坏和甲虫死亡量来确定。

在这项测验中，表1化合物抗棉铃象甲作用良好。尤其是化合物1.01，1.14，1.15，1.86，1.91和1.93的作用率大于80%。

实施例B11：抗棉粉虱的作用

矮豆植物放在网中，将棉粉虱成虫（白蝇）移植其上。产卵后，移去所有成虫，10天后，此植物和其上的若虫用由水溶性乳状液制备的含有效成分400ppm的喷雾液进行处理。使用有效成分14天后，用比较这批和未处理过那批的孵化百分数来评价。

在这项测验中，表1化合物的抗棉粉虱作用良好。尤其是化合物1.01，1.06，1.07，1.14，1.86，1.107和1.108的作用率大于80%。

实施例B12：抗丝光绿蝇（*Lucilia cuprina*）的作用

丝光绿蝇属的*Cuprina*绿蝇新产的卵的一小部分（30—50个卵）放入试管中，其中4ml营养介质事先与1ml含16ppm有效成分的溶液混合。在给培养介质接种以后，此试管用棉球密封起来在孵化器中30℃下孵化4天。到时间之后，长度约1cm的幼虫（第3阶段）在未处理介质中长出来。如果成分是有有效的，这些幼虫

或者在这样长的时间中死亡或其生长明显放慢。96小时后评价。

在这项测验中，表1化合物抗Cuprina绿蝇作用良好。