



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 91109409.1

[51] Int.Cl⁵
C07D417/06

[43] 公开日 1992 年 4 月 22 日

[22] 申请日 91.9.30

[30] 优先权

[32] 90.10.5 [33] CH [31] 03219/90-7

[32] 91.6.4 [33] CH [31] 01648/91-5

[71] 申请人 希巴-盖吉股份公司

地址 瑞士巴塞尔

[72] 发明人 皮特美恩非舍 奥德克里斯笛森
劳伦斯吉塞尔

[74] 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利
代理部
代理人 黄革生

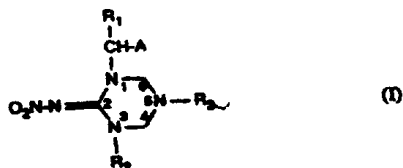
C07D401/06 A01N 47/42
// (C07D417/06, 215: 68, 213: 61)

说明书页数: 91 附图页数:

[54] 发明名称 三氮杂环己烷衍生物

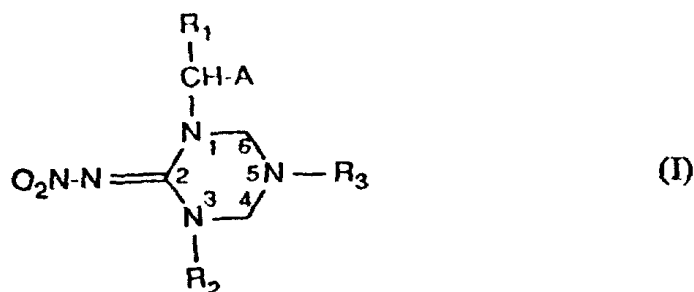
[57] 摘要

式 I 的三氮杂环己烷新衍生物及其与无机酸形成的盐具有有用的杀虫作用。本发明叙述了含有这些化合物的组合物和它们的制备方法以及它们在农业上作为农药尤其是杀虫剂和杀螨剂的应用。



权 利 要 求 书

1. 式 I 的化合物或其与无机酸形成的盐:



式中

R_1 为氢或 $C_1 - C_4$ 烷基;

R_2 为氢, $C_1 - C_6$ 烷基, $C_3 - C_6$ 环烷基或残基 $-CH_2B$;

R_3 为氢; $C_1 - C_{10}$ 烷基; $C_3 - C_6$ 环烷基; 被 1-12 个以下残基取代的 $C_1 - C_{10}$ 烷基: 卤素、羟基、 $C_1 - C_4$ 烷氧基、带有 1-9 个卤原子的 $C_1 - C_4$ 卤代烷氧基、二- ($C_1 - C_4$ 烷基) 氨基和 $C_1 - C_5$ 烷氧羰基; 被 1-4 个 $C_1 - C_4$ 烷基或卤原子取代的 $C_3 - C_6$ 环烷基; $C_2 - C_8$ 链烯基或 $C_2 - C_8$ 炔基; 分别被 1-6 个卤原子取代的 $C_2 - C_8$ 链烯基或 $C_2 - C_8$ 炔基; 苯基; 苄基; 分别被 1-3 个以下环取代基取代的苯基或苄基: 卤原子、 $C_1 - C_4$ 烷基、带有 1-9 个卤原子的 $C_1 - C_4$ 卤代烷基、 $C_1 - C_4$ 烷氧基、带有 1-9 个卤原子的 $C_1 - C_4$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_4$ 烷硫基、硝基和氰基;

A 为未被取代或一至四取代的芳族或非芳族单环或双环杂环残

基，它可带有 1—2 个以下取代基：带有 1—7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷基、环丙基、带有 1—3 个卤原子的卤代环丙基、 $C_2 - C_3$ 链烯基、 $C_2 - C_3$ 炔基、各带有 1—4 个卤原子的 $C_2 - C_3$ 卤代链烯基和 $C_2 - C_3$ 卤代炔基、带有 1—7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_3$ 烷硫基、带有 1—7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 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；且可带有 1—4 个如下取代基： $C_1 - C_3$ 烷基、 $C_1 - C_3$ 烷氧基和卤原子；及

B 为苯基；氰基苯基；硝基苯基；带有 1—3 个卤原子的卤代苯基；被 $C_1 - C_3$ 烷基、带有 1—7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷基、 $C_1 - C_3$ 烷氧基或带有 1—7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷氧基取代的苯基；3—吡啶基；5—噻唑基；被 1—2 个以下取代基取代的 5—噻唑基： $C_1 - C_3$ 烷基、带有 1—7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷基、环丙基、卤代环丙基、 $C_2 - C_3$ 链烯基、 $C_2 - C_3$ 炔基、 $C_1 - C_3$ 烷氧基、各带有 1—4 个卤原子的 $C_2 - C_3$ 卤代链烯基和 $C_2 - C_3$ 卤代炔基、带有 1—7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_3$ 烷硫基、带有 1—7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 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；被 1—2 个以下残基取代的 3—吡啶基：带有 1—7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷基、环丙基、卤代环丙基、 $O_2 - O_2$ 链烯基、 $O_2 - O_2$ 炔基、各带有 1—4 个卤原子的 $O_2 - O_2$ 卤代链烯基和 $O_2 - O_2$ 卤代炔基、带有 1—7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_3$ 烷硫基、带有 1—7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷硫基、烯丙氧基、炔丙氧基、炔丙硫基、卤

代烯丙氧基、卤代烯丙硫基、氰基和硝基；或被 1-4 个以下残基取代的 3-吡啶基： C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 烷氧基和卤素；

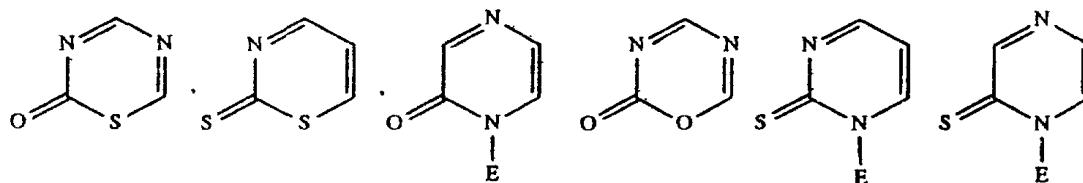
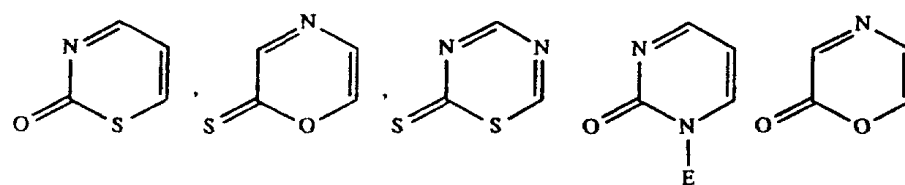
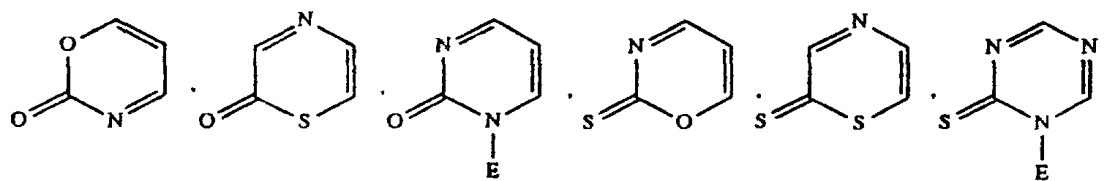
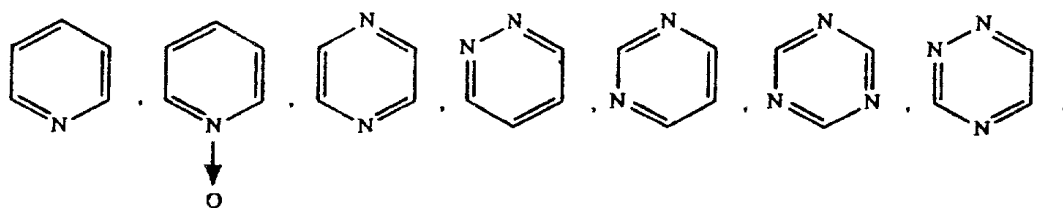
2. 根据权利要求 1 的式 I 化合物或其与无机酸形成的盐，其中 R_1 为 O_1-O_{10} 烷基， O_1-O_6 环烷基，被 1-12 个以下残基取代的 O_1-O_{10} 烷基，卤素、羟基、 O_1-O_4 烷氧基、带有 1-9 个卤原子的 O_1-C_4 卤代烷氧基、二- $(C_1-C_4$ 烷基)氨基和 C_1-C_5 烷氧羰基；被 1-4 个 C_1-C_4 烷基或卤原子取代的 C_3-C_6 环烷基； C_2-C_8 链烯基或 C_2-C_8 炔基；分别被 1-6 个卤原子取代的 C_2-C_8 链烯基或 C_2-C_8 炔基；苯基；苄基；各被 1-3 个以下环取代基取代的苯基或苄基；卤原子、 C_1-C_4 烷基、带有 1-9 个卤原子的 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、带有 1-9 个卤原子的 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、硝基和氰基； R_1 、 R_2 和 A 的定义同权利要求 1。

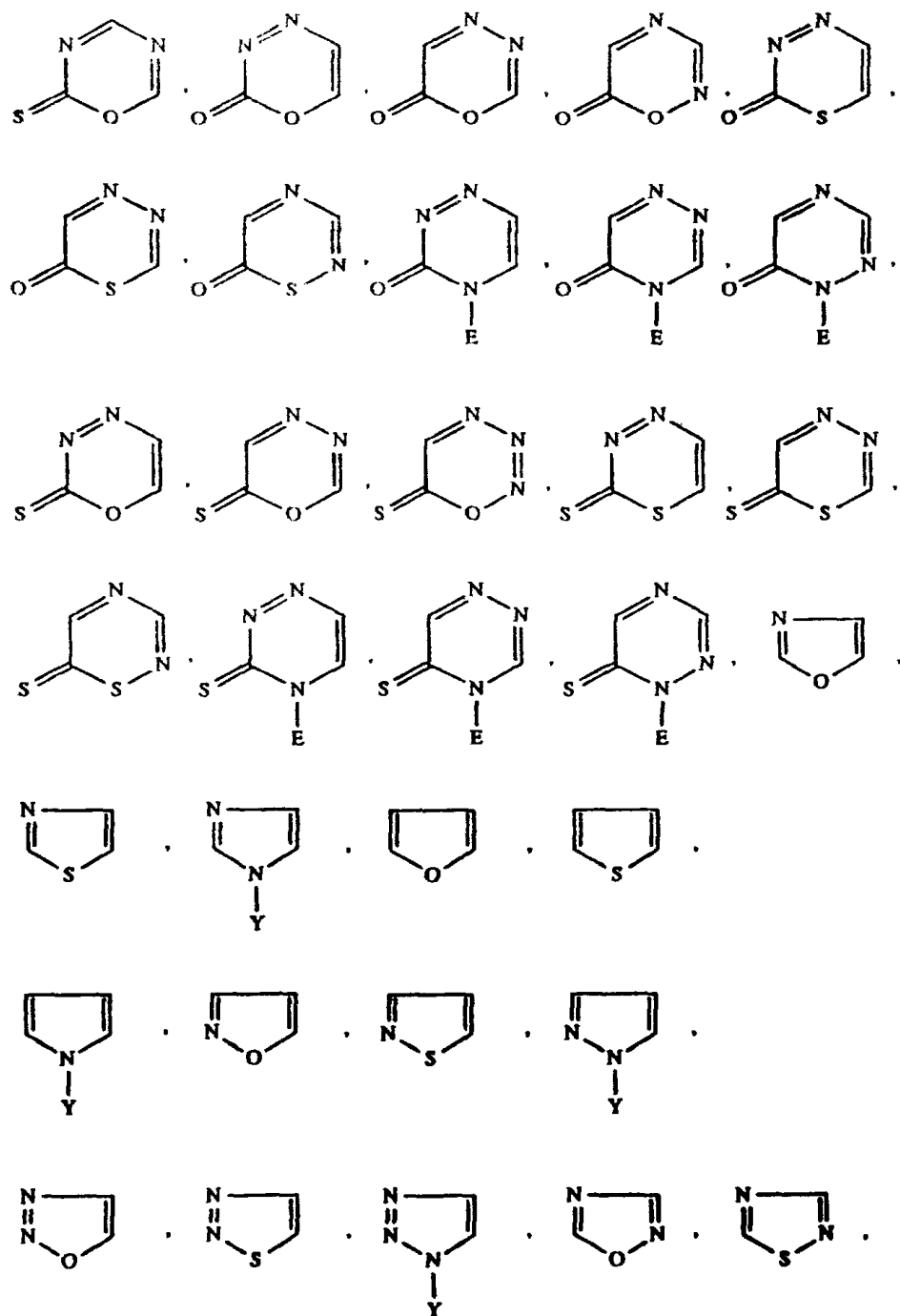
3. 根据权利要求 1 或 2 的化合物，其中杂环残基 A 为不饱和基团，它通过一碳原子与式 I 化合物分子的残基相连且至少含有一个氮原子。

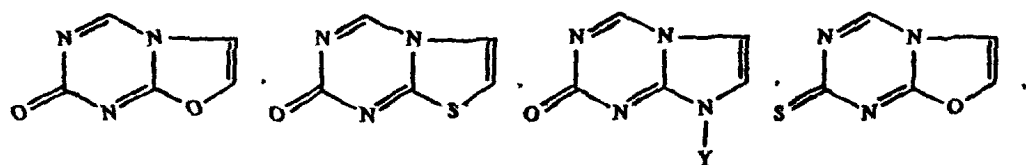
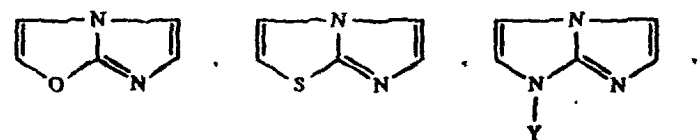
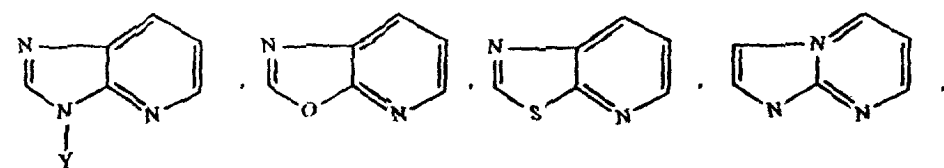
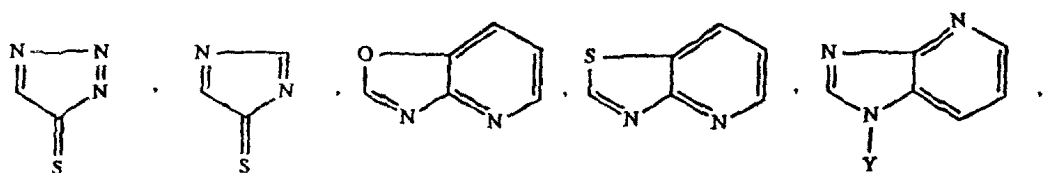
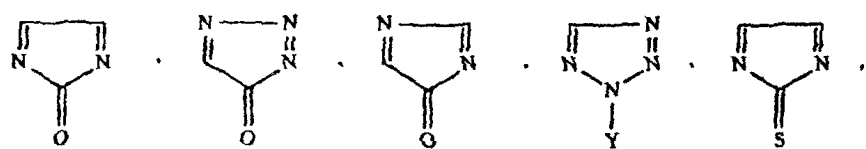
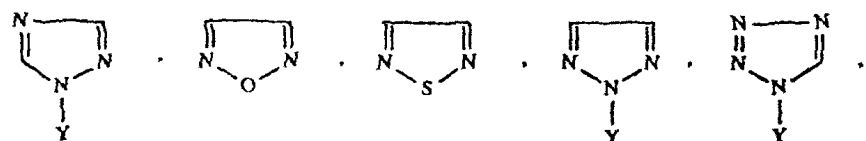
4. 根据权利要求 3 的化合物，其中杂环残基 A 不饱和，它通过一碳原子与式 I 化合物分子的残基相连，且含有 1-3 个选自氧、硫和氮的杂原子，其中氧原子或硫原子不多于 1 个。

5. 根据权利要求 4 的化合物，其中杂环残基 A 含有 1-3 个选自氧、硫和氮的杂原子，其中一个杂原子总是氮，氧或硫不多于 1 个。

6. 根据权利要求 1 或 2 的化合物，其中通过碳原子与式 I 化合物分子的残基相连的杂环残基 A 具有以下基团的基本杂环结构：







该基本结构不饱和，且根据环系统上可能具有的取代数可带有最多 4 个权利要求 1 的取代基，并且 E 为 $C_1 - C_3$ 烷基，Y 为氢、 $C_1 - C_3$ 烷基或环丙基。

7. 根据权利要求 6 的化合物，其中杂环残基 A 不饱和，且带有 1 - 3 个以下取代基：卤素， $C_1 - C_3$ 烷基，各带有 1 - 7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷基和 $C_1 - C_3$ 卤代烷氧基以及 $C_1 - C_3$ 烷氧基。

8. 根据权利要求 7 的化合物，其中残基 A 为吡啶或噻唑。

9. 根据权利要求 1 或 2 的化合物，其中残基 B 为苯基、未被取代或被 1 - 2 个以下残基取代的吡啶基或噻唑基；卤素、 $C_1 - C_3$ 烷基、各带有 1 - 7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷基和 $C_1 - C_3$ 卤代烷氧基，和 $C_1 - C_3$ 烷氧基。

10. 根据权利要求 7 的化合物，其中残基 A 为 3 - 吡啶基、2 - 卤吡啶 - 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 - 基或 1 - 氧代 - 2, 3 - 二卤代吡啶 - 5 - 基。

11. 根据权利要求 1 或 2 的化合物，其中 R_1 为氢， R_2 为甲基、乙基或环丙基，A 为吡啶基、1 - 氧代吡啶基或噻唑基、或各被 1 - 3 个以下取代基取代的吡啶基、1 - 氧代吡啶基或噻唑基；卤素、 $C_1 - C_3$ 烷基、各带有 1 - 7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷基和 $C_1 - C_3$ 卤代烷氧基和 $C_1 - C_3$ 烷氧基。

12. 根据权利要求 1 或 2 的化合物，其中 R_1 为氢。

13. 根据权利要求 12 的化合物，其中 R_1 为氢， R_2 为甲基。

14. 根据权利要求1和3-13中任一项的化合物, 其中 R_3 为 C_1-C_6 烷基、环丙基、环己基、苯基、苄基或残基 $-CH_2-COO-CH_3$ 。

15. 根据权利要求13的化合物, 其中 R_3 为被1-3个以下环取代基取代的苄基: 氟、氯、溴、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 卤代烷基、 C_1-C_2 烷氧基、 C_1-C_2 烷硫基、硝基和氰基。

16. 根据权利要求13的化合物, 其中 R_3 为被1-3个以下环取代基取代的苯基: 氟、氯、溴、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 卤代烷基、 C_1-C_2 烷氧基、 C_1-C_2 烷硫基、硝基和氰基。

17. 根据权利要求13的化合物, 其中 R_3 为被羟基取代的 C_1-C_6 烷基。

18. 根据权利要求13的化合物, 其中 R_3 为被 C_1-C_5 烷氧羰基取代的 C_1-C_6 烷基。

19. 根据权利要求13的化合物, 其中 R_3 为 CH_2CH_2F 、 $-CH_2CH_2Br$ 、 $-CH_2CH_2CH_2Cl$ 、 $-CH_2CH_2CH_2Br$ 、或 $-CH_2CHClCH_2CH_2CH_2Cl$ 。

20. 根据权利要求13的化合物, 其中 R_3 为 $-CH_2CH_2O-CH_3$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-O-CH_2CH_3$ 、 $CH(CH_3)CH_2-O-CH_3$ 、 $-CH_2CH(OCH_3)_2$ 、 $-CH_2CH_2-N(CH_2CH_3)_2$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$ 或 $-CH_2CH_2CH_2-N(CH_2CH_3)_2$ 。

21. 根据权利要求13的化合物, 其中 R_3 为未被取代或被1-2个 C_1-C_4 烷基取代的 C_4-C_6 环烷基。

22. 根据权利要求21的化合物, 其中 R_1 为环戊基或环己基。

23. 根据权利要求21的化合物, 其中 R_1 为被1-2个甲基取代的 C_1-C_6 环烷基。

24. 根据权利要求1或11中任一项的化合物, 其中A为2-氯噻唑-4-基、2,3-二氯吡啶-5-基、1-氧代吡啶-3-基或1-氧代-2-氯吡啶-5-基; R_2 为甲基, R_3 为环丙基、 $-CH_2CH_2Cl$ 、 $-CH_2CH(OCH_3)_2$ 或 $-CH_2CH_2N(CH_3)_2$ 。

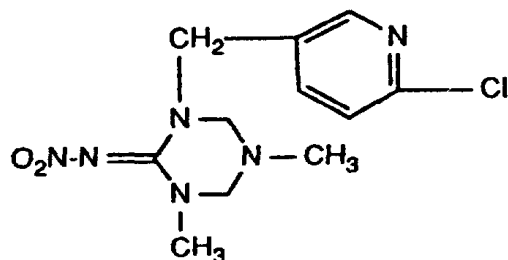
25. 根据权利要求1-24的化合物, 其中A为2-氯噻唑-4-基。

26. 根据权利要求1-24的化合物, 其中A为2-氯吡啶-5-基。

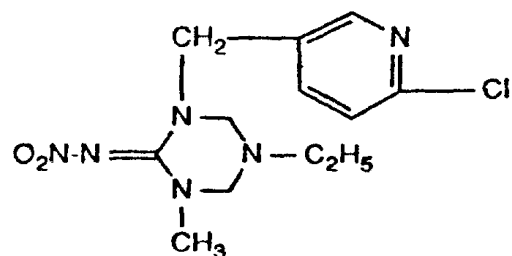
27. 根据权利要求1-7的化合物, 其中A为1-氧代-2-氯吡啶-5-基或1-氧代吡啶-5-基。

28. 根据权利要求1的化合物, 其中A为2-氯吡啶-5-基、2,3-二氯吡啶-5-基、2-氯噻唑-4-基、1-氧代吡啶-3-基或1-氧代-2-氯吡啶-5-基; R_1 为氢; R_2 为甲基; R_3 为正丙基。

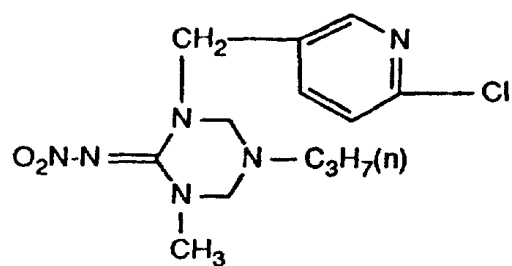
29. 根据权利要求26的下式化合物:



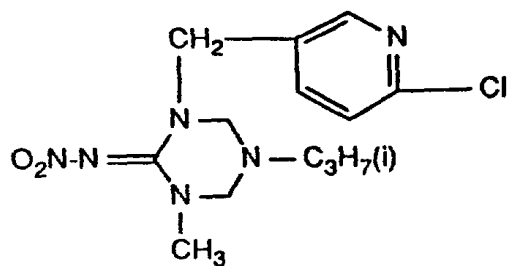
3 0 . 根据权利要求 2 6 的下式化合物:



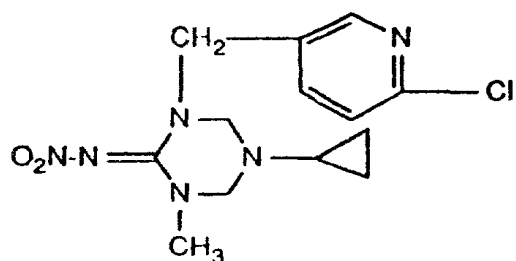
3 1 . 根据权利要求 2 6 的下式化合物:



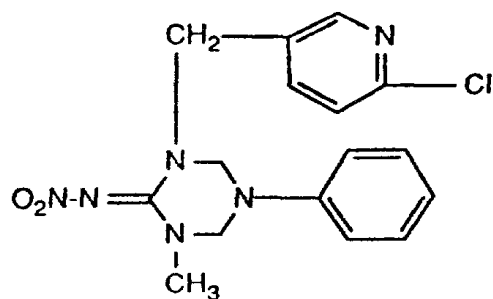
3 2 . 根据权利要求 2 6 的下式化合物:



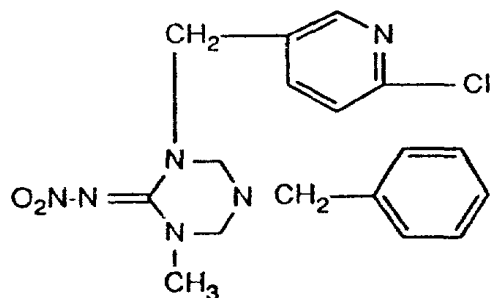
3 3 . 根据权利要求 2 6 的下式化合物:



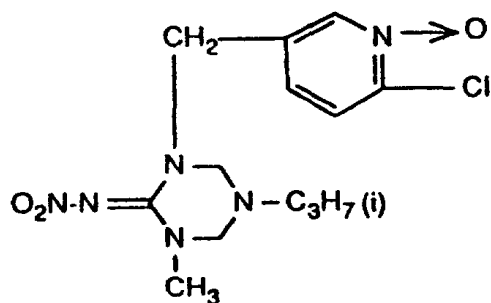
34. 根据权利要求26的下式化合物：



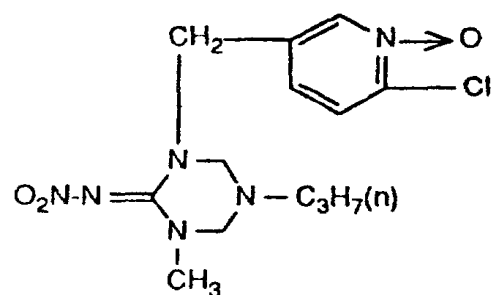
35. 根据权利要求26的下式化合物：



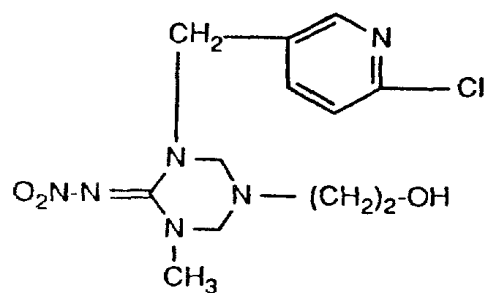
36. 根据权利要求14的下式化合物：



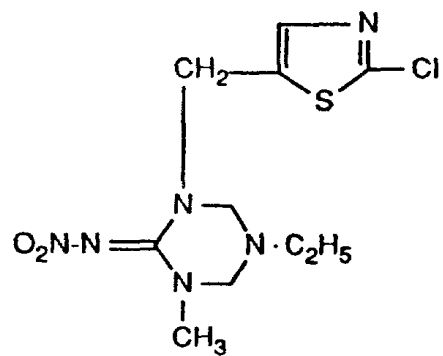
3 7. 根据权利要求 1 4 的下式化合物:



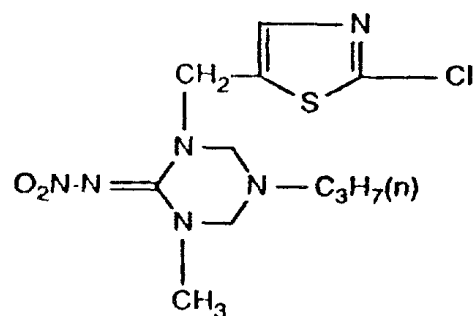
3 8. 根据权利要求 2 6 的下式化合物:



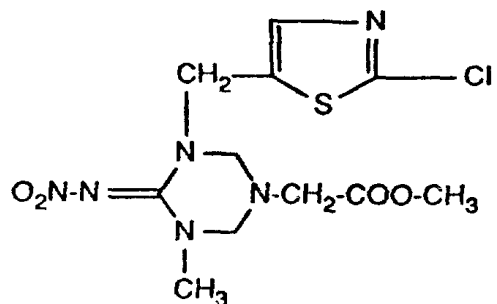
3 9. 根据权利要求 2 5 的下式化合物:



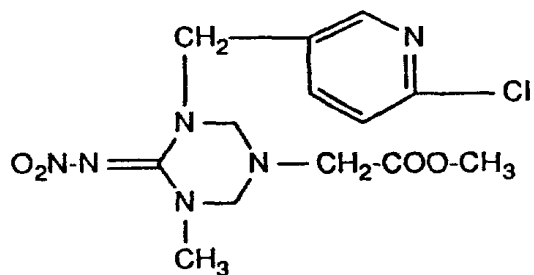
4 0. 根据权利要求 2 7 的下式化合物:



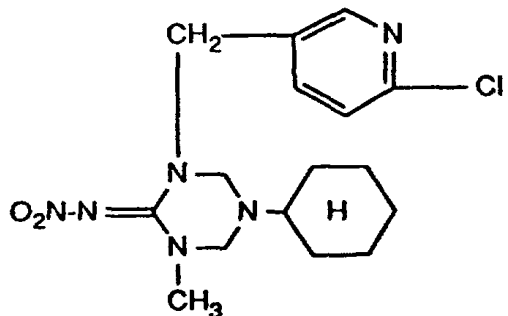
4.1. 根据权利要求 1.4 的下式化合物:



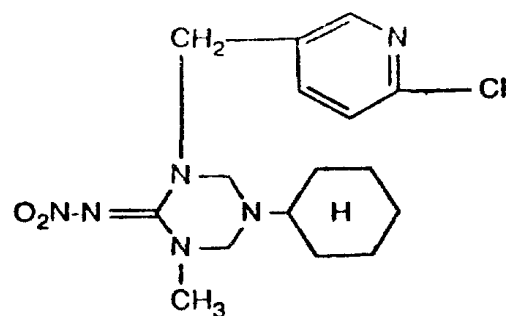
4.2. 根据权利要求 1.4 的下式化合物:



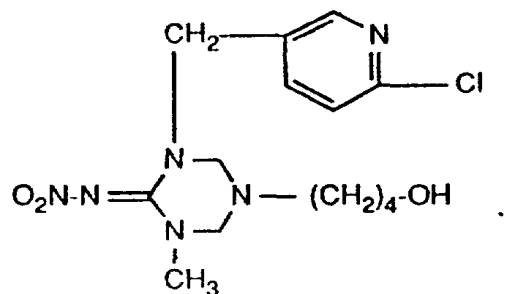
4.3. 根据权利要求 1.4 的下式化合物:



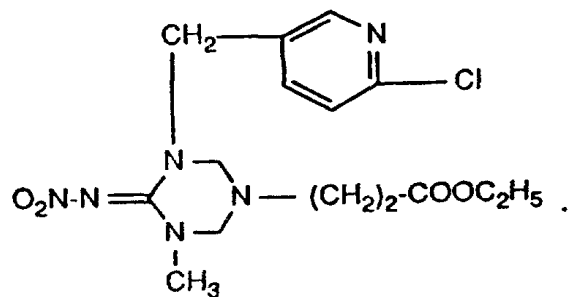
4.4. 根据权利要求 1.4 的下式化合物:



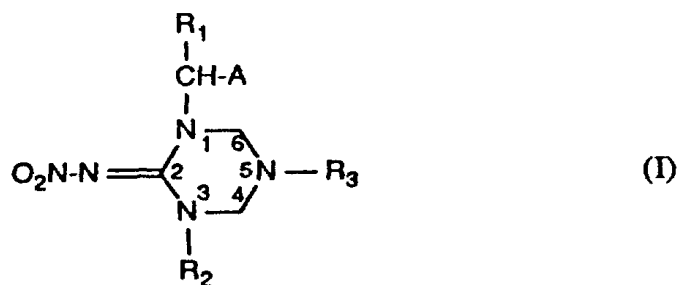
4 5. 根据权利要求 2 6 的下式化合物:



4 6. 根据权利要求 2 6 的下式化合物:



4 7. 一种制备权利要求 1 式 I 化合物或其与无机酸形成的盐的方法



其中

R_1 为氢或 $C_1 - C_4$ 烷基；

R_2 为氢， $C_1 - C_6$ 烷基， $C_3 - C_6$ 环烷基或残基 $-CH_2 B$ ；

R_3 为氢； $C_1 - C_{10}$ 烷基； $C_3 - C_6$ 环烷基；被 1—12 个以下残基取代的 $C_1 - C_{10}$ 烷基；卤素、羟基、 $C_1 - C_4$ 烷氧基、带有 1—9 个卤原子的 $C_1 - C_4$ 卤代烷氧基、二- ($C_1 - C_4$ 烷基) 氨基和 $C_1 - C_6$ 烷氧羰基；被 1—4 个 $C_1 - C_4$ 烷基或卤原子取代的 $C_3 - C_6$ 环烷基； $C_2 - C_8$ 链烯基或 $C_2 - C_8$ 炔基；分别被 1—6 个卤原子取代的 $C_2 - C_8$ 链烯基或 $C_2 - C_8$ 炔基；苯基；苄基；分别被 1—3 个以下环取代基取代的苯基或苄基；卤原子、 $C_1 - C_4$ 烷基、带有 1—9 个卤原子的 $C_1 - C_4$ 卤代烷基、 $C_1 - C_4$ 烷氧基、带有 1—9 个卤原子的 $C_1 - C_4$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_4$ 烷硫基、硝基和氰基；

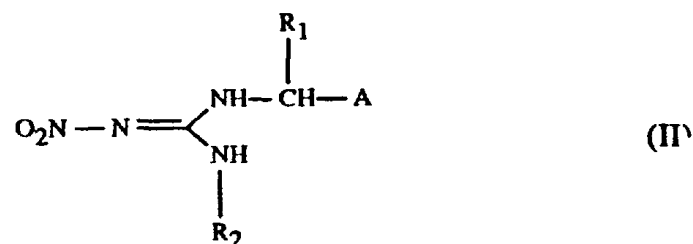
A 为未被取代或一至四取代的芳族或非芳族单环或双环杂环残基，它可带有 1—2 个以下取代基：带有 1—7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷基、环丙基、带有 1—3 个卤原子的卤代环丙基、 $C_2 - C_3$ 链烯基、 $C_2 - C_3$ 炔基、各带有 1—4 个卤原子的 $C_2 - C_3$ 卤代链烯基和 $C_2 - C_3$ 卤代炔基、带有 1—7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_3$ 烷硫基、带有 1—7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷硫基、烯丙氧基、炔丙氧基、烯丙硫基、炔丙硫基、卤代烯丙氧基、卤代烯丙硫基、氰基和硝基；且可带有 1—4 个如下取代基： $C_1 - C_3$ 烷基、 $C_1 - C_3$ 烷氧基和卤原子；及

B 为苯基；氰基苯基；硝基苯基；带有 1—3 个卤原子的卤代苯基；被 $C_1 - C_3$ 烷基、带有 1—7 个卤原子的 $C_1 -$

C_1 ，卤代烷基、 $C_1 - C_3$ 烷氧基或带有 1-7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷氧基取代的苯基；3-吡啶基；5-噻唑基；被 1-2 个以下取代基取代的 5-噻唑基； $C_1 - C_3$ 烷基、带有 1-7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷基、环丙基、卤代环丙基、 $C_2 - C_3$ 链烯基、 $C_2 - C_3$ 炔基、 $C_1 - C_3$ 烷氧基、各带有 1-4 个卤原子的 $C_2 - C_3$ 卤代链烯基和 $C_2 - C_3$ 卤代炔基、带有 1-7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_3$ 烷硫基、带有 1-7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 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；被 1-2 个以下残基取代的 3-吡啶基；带有 1-7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷基、环丙基、卤代环丙基、 $O_1 - O_3$ 链烯基、 $O_2 - O_3$ 炔基、各带有 1-4 个卤原子的 $O_2 - O_3$ 卤代链烯基和 $O_2 - O_3$ 卤代炔基、带有 1-7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_3$ 烷硫基、带有 1-7 个卤原子的 $C_1 - C_3$ 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；或被 1-4 个以下残基取代的 3-吡啶基： $C_1 - C_3$ 烷基、 $C_1 - C_3$ 烷氧基和卤素，

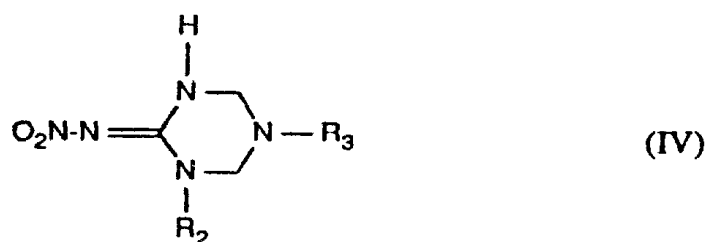
该方法包括：

a) 将式 II 化合物与甲醛或仲甲醛以及式 III 化合物反 I



或

b) 将式 N 化合物与式 V 化合物反应



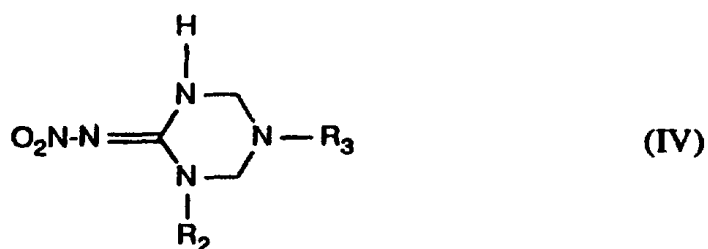
或

c) 对于制备其中 R_2 不是氢的式 I 化合物, 是将所产生的其中 R_2 为氢的式 I 化合物与式 VI 化合物反应



并且根据需要, 将所产生的式 I 化合物转化为盐; 式 II - VI 中 R_1 、 R_2 、 R_3 和 A 的定义同权利要求 1, X 为卤原子, Y 为离去基团。

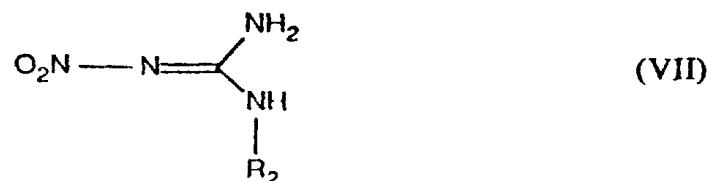
48. 根据权利要求 47 的式 N 化合物



其中 R_2 和 R_3 的定义同权利要求 1, 例外的是 2-硝基亚氨基-5-甲基-1, 3, 5-三氮杂环己烷和 2-硝基亚氨基-1, 3, 5

—三氮杂环己烷。

49. 制备权利要求48的式Ⅳ化合物的方法，它包括将式Ⅶ化合物与甲醛或仲甲醛以及式Ⅲ化合物反应



式Ⅶ和Ⅲ中 R_2 和 R_3 的定义同权利要求1。

50. 包含有权利要求1—46中任一项化合物作为活性成分以及合适载体和/或其它助剂的农药组合物。

51. 权利要求1—46中任一项的化合物在控制动、植物昆虫和典型蜚蠊目中的应用。

52. 权利要求51的用途，它用于控制破坏植物的昆虫。

53. 权利要求52的用途，它用于控制刺吸式昆虫。

54. 控制昆虫和典型蜚蠊目的方法，其中是将杀虫有效量的权利要求1—46中任一项的式Ⅰ化合物或含有杀虫有效量的该化合物和助剂及载体的组合物与害虫，其各个发育期或其所在的位置接触或处理。

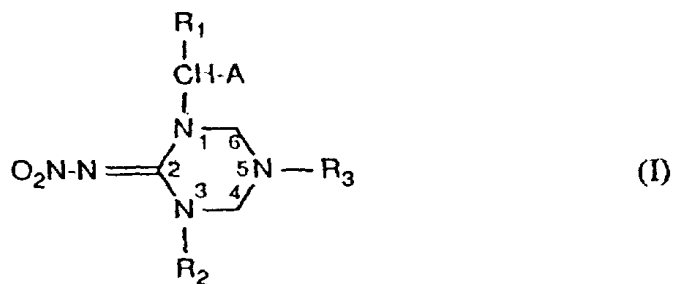
55. 根据权利要求54的方法，用于控制破坏植物昆虫。

56. 根据权利要求55的方法，用于控制刺吸式昆虫。

三氮杂环己烷衍生物

本发明涉及新的取代 2-硝基亚氨基-1, 3, 5-三氮杂环己烷衍生物, 它们的制备方法, 含有它们的农药及其在控制害虫方面的应用。

本发明的三氮杂环己烷衍生物对应于通式 I 或其与无机酸形成的盐：



式中

R_1 为氢或 $C_1 - C_4$ 烷基;

R_2 为氢、 $C_1 - C_6$ 烷基、 $C_3 - C_6$ 环烷基或残基 $-CH_2B$;

R_3 为氢; $C_1 - C_{10}$ 烷基; $C_3 - C_6$ 环烷基; 被 1—12 个以下基团取代的 $C_1 - C_{10}$ 烷基: 卤素, 羟基, $C_1 - C_4$ 烷氧基, 具有 1—9 个卤原子的 $C_1 - C_4$ 卤代烷氧基, 二-($C_1 - C_4$ 烷基)氨基和 $C_1 - C_5$ 烷氧羰基; 被 1—4 个 $C_1 - C_4$ 烷基或卤原子取代的 $C_3 - C_6$ 环烷基; $C_2 - C_8$ 链烯基或 $C_2 - C_8$ 炔基; 被 1—6 个卤原子取代的 $C_2 - C_8$ 链烯基或 $C_2 - C_8$ 炔基; 苯基;

苄基；被1-3个以下环取代基所取代的苯基或苄基：卤原子， $C_1 - C_4$ 烷基，具有1-9个卤原子的 $C_1 - C_4$ 卤代烷基， $C_1 - C_4$ 烷氧基，具有1-9个卤原子的 $C_1 - C_4$ 卤代烷氧基， $C_1 - C_4$ 烷硫基，硝基和氰基；

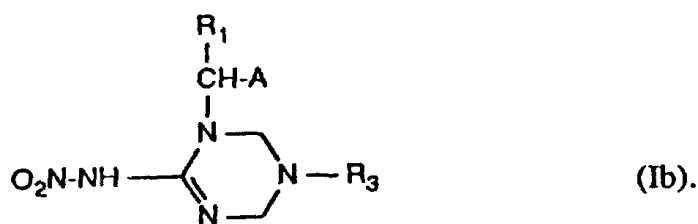
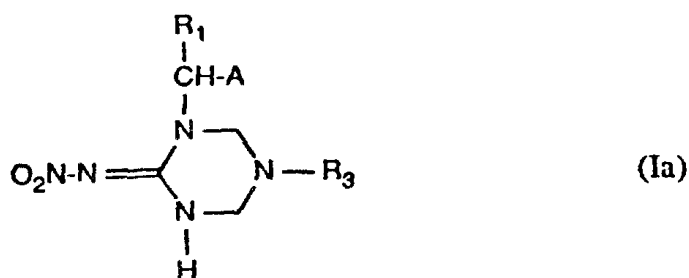
A为未被取代的或一至四取代的芳族或非芳族单环或双环杂环基团，它可被1-2个以下基团取代：具有1-7个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷基、环丙基、具有1-3个卤原子的卤代环丙基、 $C_2 - C_3$ 链烯基、 $C_2 - C_3$ 炔基、分别带有1-4个卤原子的 $C_2 - C_3$ 卤代链烯基或 $C_2 - C_3$ 卤代炔基、带有1-7个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_3$ 烷硫基、带有1-7个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷硫基、烯丙氧基、炔丙氧基、烯丙硫基、炔丙硫基、卤代烯丙氧基、卤代烯丙硫基、氰基和硝基，且可被1-4个以下取代基所取代： $C_1 - C_3$ 炔基、 $C_1 - C_3$ 烷氧基和卤素；

B为苯基；氰苯基；硝基苯基；带有1-3个卤原子的卤代苯基；被 $C_1 - C_3$ 烷基、带有1-7个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷基、 $C_1 - C_3$ 烷氧基或带有1-7个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷氧基所取代的苯基；3-吡啶基；5-噻唑基；被1-2个以下取代基所取代的5-噻唑基： $C_1 - C_3$ 烷基、带有1-7个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷基、环丙基、卤代环丙基、 $C_2 - C_3$ 链烯基、 $C_2 - C_3$ 炔基、 $C_1 - C_3$ 烷氧基、分别带有1-4个卤原子的 $C_2 - C_3$ 卤代链烯基和 $C_2 - C_3$ 卤代炔基、具有1-7个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_3$ 烷硫基、带有1-7个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷硫基、烯丙氧基、烯炔氧基、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；或被1-2个以下

基团取代的 3-吡啶基：带有 1-7 个卤原子的 C_1-C_7 ，卤代烷基、环丙基、卤代环丙基、 C_2-C_7 ，链烯基、 C_2-C_7 ，炔基、分别带有 1-4 个卤原子的 C_2-C_7 ，卤代链烯基和 C_3-C_7 ，卤代炔基、带有 1-7 个卤原子的 C_1-C_7 ，卤代烷氧基、 C_1-C_7 ，烷硫基、带有 1-7 个卤原子的 C_1-C_7 ，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，或被 1-4 个以下基团取代的 3-吡啶基： C_1-C_7 ，烷基、 C_1-C_7 ，烷氧基和卤素。

本发明式 I 化合物也包括它与农业化学上可耐受的无机酸形成的盐。这类酸的例子有：盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸和硝酸，还包括具有同样的中心原子且被不同程度氧化的酸，例如高氯酸、亚硝酸或亚磷酸。

当 R_2 为氢原子时，式 I 化合物可出现 I_a 或 I_b 的互变异构体形式：



式 I 化合物也可出现针对 $N=C(2)$ 的双键异构体。

因此，应将本发明的式 I 理解为包括式 I_a、式 I_b 和双键异构体。

本发明式 I 的定义中，应将各个术语理解为分别具有以下意义：

作为取代基的卤原子是氟、氯、溴和碘，优选的是氟、氯和溴。这里的卤原子应被理解为单独的取代基或为取代基的一部分，例如卤代烷基、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。作为取代基的烷基、烷硫基、链烯基、炔基和烷氧基可以是直链的也可以是带支链的。可提到的这种烷基的例子有甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基和叔丁基。特别合适的烷氧基是：甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基或丁氧基及其异构体。烷硫基的例子有甲硫基、乙硫基、异丙硫基、丙硫基或丁硫基的异构体。如果作为取代基的烷基、烷氧基、链烯基、炔基或环烷基被卤原子取代，则它们既可以被部分卤化，也可以被全卤化。这里卤素、烷基和烷氧基的定义同上。这些基团中烷基成分的例子有：被氟、氯和/或溴取代 1—3 次的甲基，如 CHF_2 ，或 CF_3 ；被氟、氯和/或溴取代 1—5 次的乙基，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 $CClFCHClF$ ；被氟、氯和/或溴取代 1—7 次的丙基或异丙基，如 $CH_2CHBrCH_2Br$ 、 $CF_2CHF CF_3$ 、 $CH_2CF_2CF_3$ 或 $CH(CF_3)_2$ ；被氟、氯和/或溴取代 1—9 次的丁基或其一个异构体，如 $CF(CF_3)CHF CF_3$ 或 $CH_2(CF_2)_2CF_3$ ；2-氯

一环丙基或 2, 2-二氟环丙基; 2, 2-二氟乙烯基、2, 2-二氯乙烯基、2-氯烷基、2, 3-二氯乙烯或 2, 3-二溴乙烯基。

如果所定义的烷基、烷氧基或环烷基被其它取代基所取代, 则这种取代可以是被所列的相同或不同的取代基单取代或多取代, 最好是取代基中存在一个或两个取代基。作为取代基的环烷基的例子有: 环丙基、环丁基、环戊基和环己基。含有一个不饱和的碳-碳键链烯基和炔基的典型例子有烯丙基、甲基烯丙基或炔丙基, 但也可以是乙烯和乙炔。烯丙氧基、炔丙氧基、烯丙硫基或炔丙硫基中的双键或三键最好被饱和碳原子从与杂原子 (O 或 S) 的连接点分开。

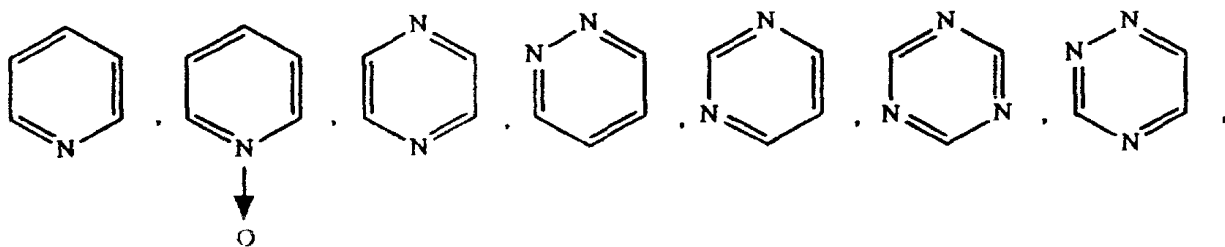
在以上所定义的式 I 化合物中, 突出的是具有以下残基的化合物:

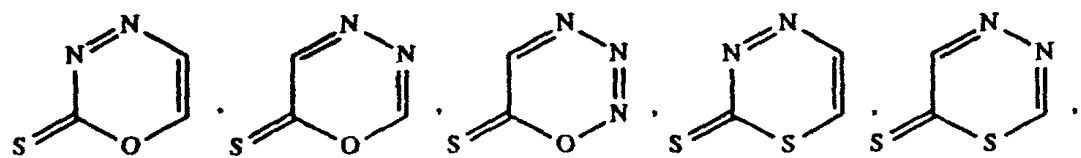
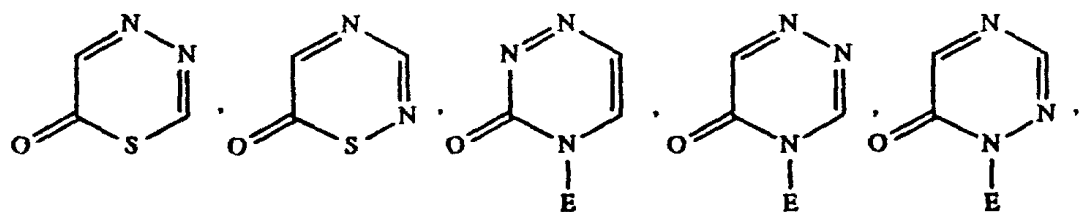
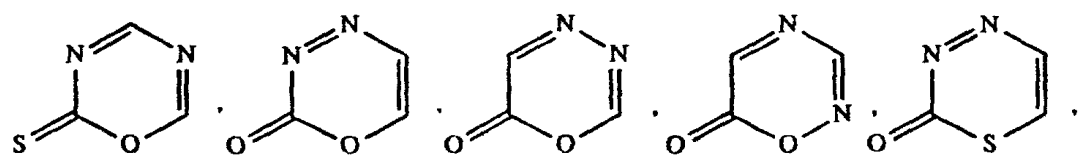
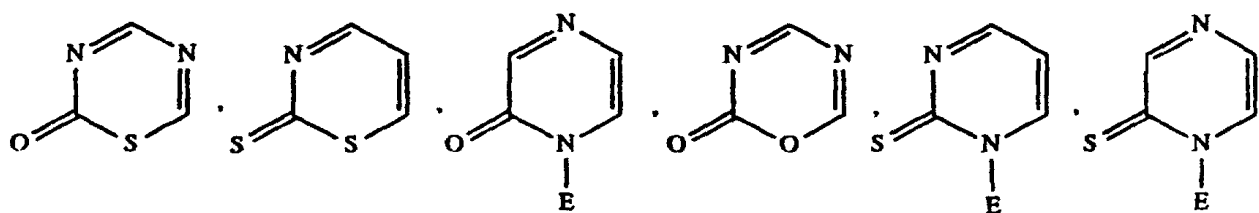
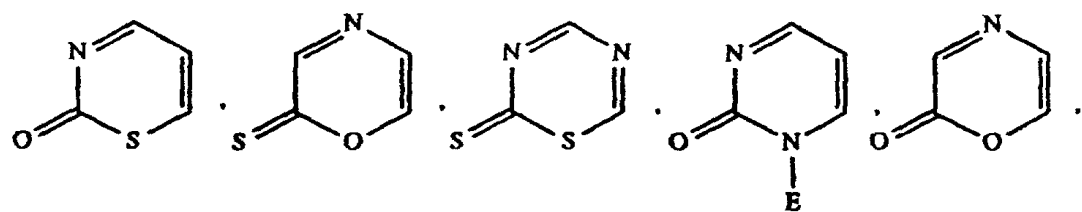
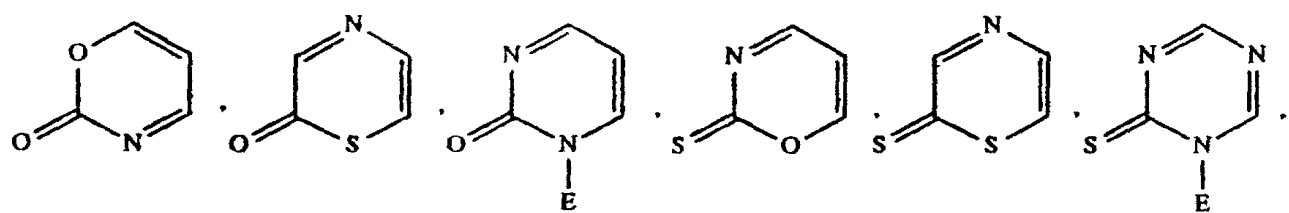
R_3 为 $C_5 - C_{10}$ 烷基; $C_3 - C_6$ 环烷基; 被 1-12 个以下残基取代的 $C_1 - C_{10}$ 烷基; 卤素、羟基、 $C_1 - C_4$ 烷氧基、具有 1-9 个卤原子的 $C_1 - C_4$ 卤代烷氧基、二- ($C_1 - C_4$ 烷基) 氨基和 $C_1 - C_5$ 烷氧羰基; 被 1-4 个 $C_1 - C_4$ 烷基或卤原子取代的 $C_3 - C_6$ 环烷基; $C_2 - C_8$ 链烯基或 $C_2 - C_8$ 炔基; 分别被 1-6 个卤原子取代的 $C_2 - C_8$ 链烯基或 $C_2 - C_8$ 炔基; 苯基; 苄基; 分别被 1-3 个以下环取代基取代的苯基或苄基: 卤素、 $C_1 - C_4$ 烷基、带有 1-9 个卤原子的 $C_1 - C_4$ 卤代烷基、 $C_1 - C_4$ 烷氧基、带有 1-9 个卤原子的 $C_1 - C_4$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_4$ 烷硫基、硝基和氰基; 且 R_1 、 R_2 和 A 的定义同上。

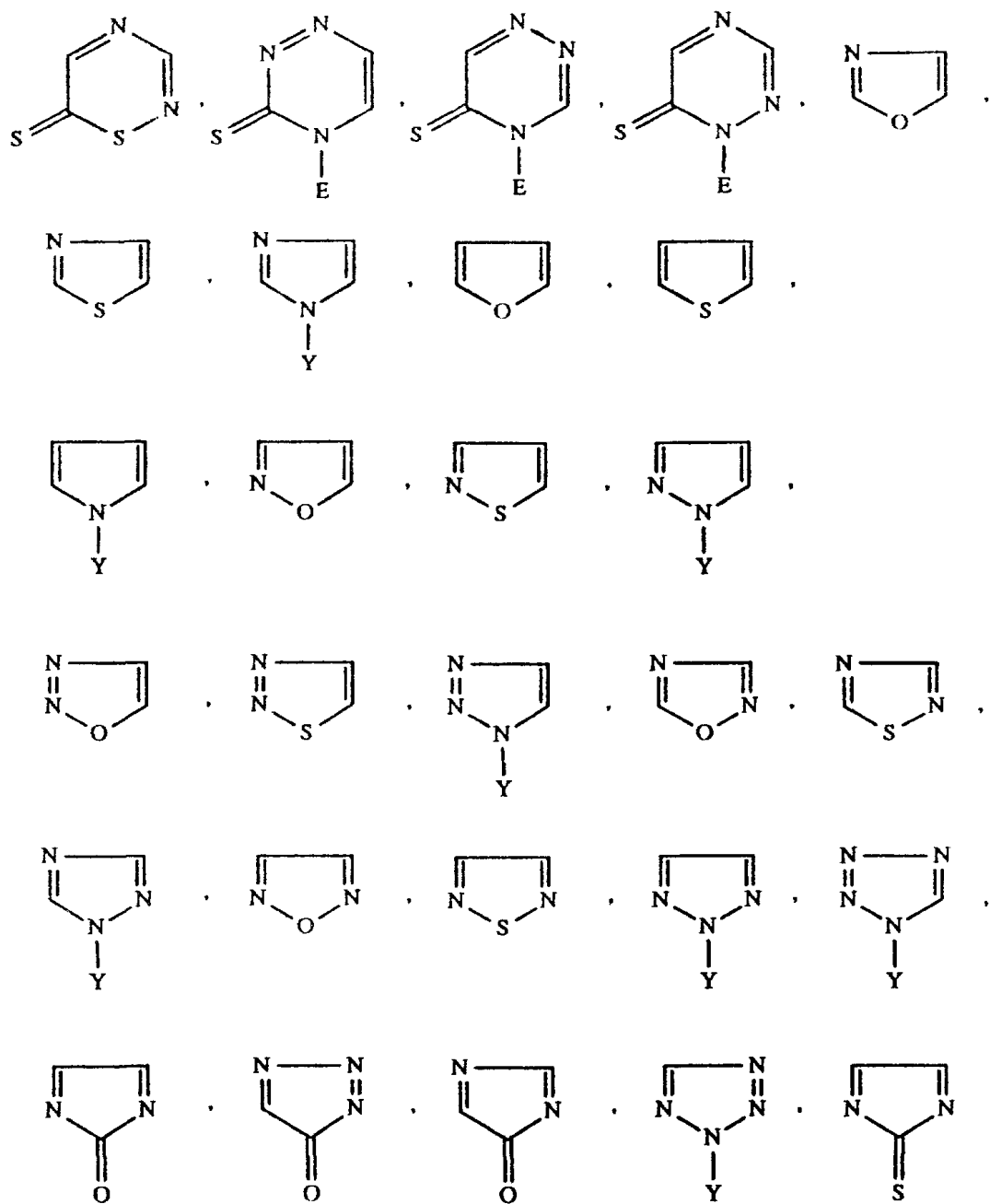
更突出的本发明式 I 化合物是: 其中杂环残基 A 为不饱和的通过碳原子与式 I 化合物分子的残基键合且至少含有一个氮原子的化合物; 其中杂环残基 A 为不饱和、通过一碳原子与式 I 化合物分子的残

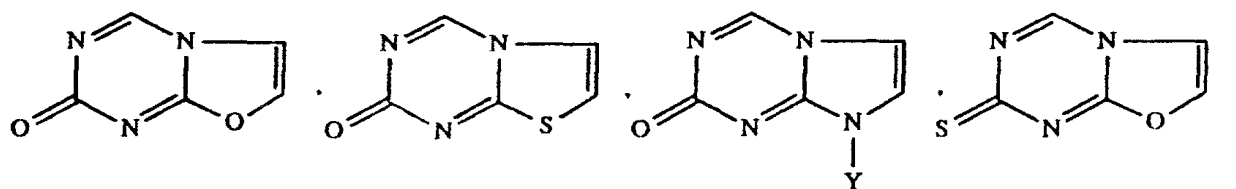
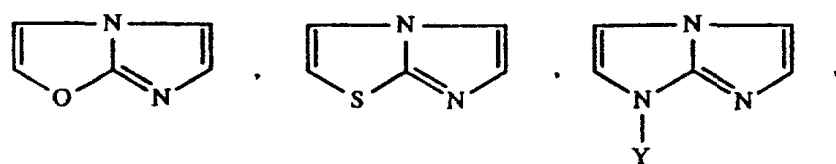
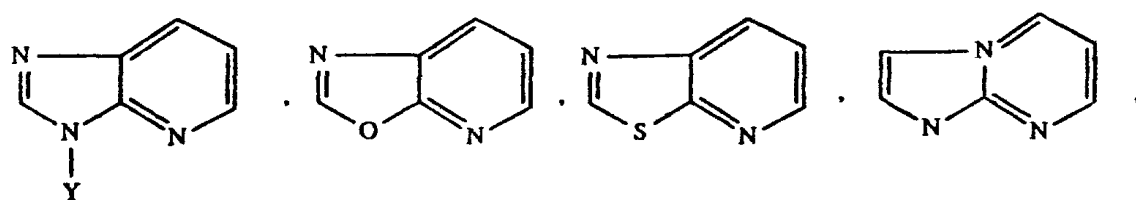
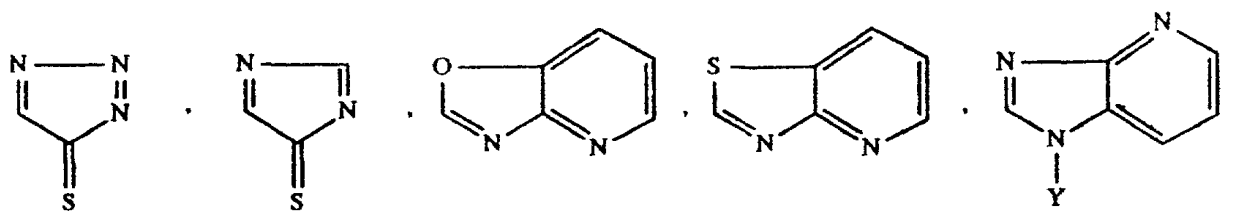
基键合且含有氧原子、硫原子和氮原子中 1—3 个杂原子（氧原子或硫原子出现的个数不多于一个）的化合物；其中杂环残基 A 含有氧、硫和氮中 1—3 个杂原子（一个杂原子通常为氮，氧原子或硫原子不多于 1 个）的化合物。

杂环残基 A 定义中所包括的环系统对于本发明式 I 化合物的生物活性很重要。这些环系统的环原子中至少含有一个杂原子。也就是说，形成基本环结构的原子中至少有一个不是碳原子。一般来说，元素周期系统中的所有原子都能够用作环原子，条件是它们能够形成至少两个共价键。杂环残基最好是不饱和的且通过一个环碳原子与式 I 的基本结构相连。定义 A 的不饱和环系统含有一个或多个双键；这种环系统最好是多不饱和的且通常具有芳族性质。优选的环系统含有至少一个氮原子作为杂原子。定义 A 中的环含有氧、硫和氮中的 1—3 个杂原子（所出现的氧或硫原子不多于 1 个）。优选的定义 A 中的环系统为其中杂环残基 A 含有选自氧、硫和氮中的 1—3 个杂原子（其中一个杂原子通常是氮，所出现的氧原子或硫原子不多于 1 个）的环系统。本发明定义 A 的杂环的例子尤其在以下基本结构基团中被发现：









上式中，E为 $C_1 - C_3$ 烷基，Y为氢、 $C_1 - C_3$ 烷基或环丙基。

以上所列举的杂环A可未被取代，或根据环系统中所可能有的取代基的数目带有最多4个式I中所述的取代基。优选这些杂环带有1-3个选自以下基团的取代基：卤素、 $C_1 - C_3$ 烷基、分别带有1-7个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷基和 $C_1 - C_3$ 卤代烷氧基和 $C_1 - C_3$ 烷氧基。最优选的杂环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。

在式I化合物中，残基B最好是苯基、吡啶基或噻唑基，它可以是未被取代的或被1个或两个以下残基取代：卤原子、 $C_1 - C_3$ 烷基、各带有1-7个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷基和 $C_1 - C_3$ 卤代烷氧基以及 $C_1 - C_3$ 烷氧基。

根据其生物作用，突出的式I化合物为其中各基团定义如下的化合物： R_1 为氢， R_2 为甲基、乙基或环丙基，A为吡啶基、1-氧代吡啶基或噻唑基，或各被1-3个以下取代基所取代的吡啶基、1-氧代吡啶基或噻唑基：卤原子、 $C_1 - C_3$ 烷基、各带有1-7个卤原子的 $C_1 - C_3$ 卤代烷基和 $C_1 - C_3$ 卤代烷氧基、 $C_1 - C_3$ 烷氧基。其中，也感兴趣的是其中各基团定义如下的式I化合物：

- a) R_1 为氢；和/或
- b) R_2 为甲基；和/或
- c) R_3 为 $C_1 - C_3$ 烷基、环丙基、环己基、苯基、苄基或残基- $CH_2 - COO - CH_3$ 。

本发明也感兴趣的是其中各基团定义如下的各类式I化合物：

R_3 为各被 1—3 个以下取代基所取代的苄基或苯基；氟、氯、溴、 $C_1 - C_3$ 烷基、 $C_1 - C_3$ 卤代烷基、 $C_1 - C_3$ 烷氧基、 $C_1 - C_3$ 烷硫基、硝基和氰基；

R_3 为被羟基取代的 $C_1 - C_6$ 烷基；

R_3 为被 $C_1 - C_5$ 烷氧羰基取代的 $C_1 - C_6$ 烷基；

R_3 为 $-CH_2CH_2F$ 、 $-CH_2CH_2Br$ 、 $-CH_2CH_2CH_2Cl$ 、 $-CH_2CH_2CH_2Br$ 或 $-CH_2CHClCH_2CH_2CH_2Cl$ ；

R_3 为 $-CH_2CH_2OCH_3$ 、 $-CH_2CH_2CH_2OCH_3$ 、 $-CH(CH_3)CH_2OCH_3$ 、 $-CH_2CH(OCH_3)_2$ 、 $-CH_2CH_2N(CH_2CH_3)_2$ 、 $-CH_2CH_2CH_2N(CH_3)_2$ 或 $-CH_2CH_2CH_2N(CH_2CH_3)_2$ ；

R_3 为未被取代或被 1—2 个 $C_1 - C_4$ 烷基取代的 $C_4 - C_6$ 环烷基；

R_3 为环戊基或环己基；

R_3 为被 1—2 个甲基取代的 $C_3 - C_6$ 环烷基；

A 为 2-氯代噻唑-4-基、2,3-二氯吡啶-5-基、1-氧代吡啶-3-基或 1-氧代-2-氯吡啶-5-基； R_2 为甲基， R_3 为环丙基、 $-CH_2CH_2Cl$ 、 $-CH_2CH(OCH_3)_2$ 或 $-CH_2CH_2N(CH_3)_2$ ；

A 为 2-氯噻唑-4-基；

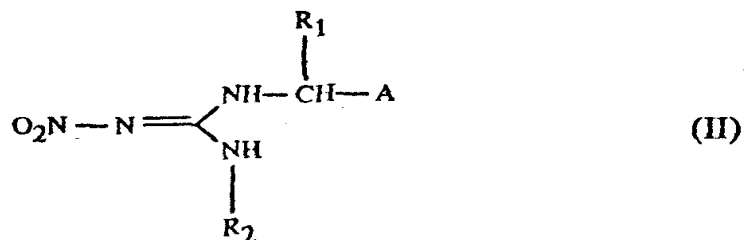
A 为 2-氯吡啶-5-基；或

A 为 2-氯吡啶-5-基、2,3-二氯吡啶-5-基、2-氯

噻唑-4-基。1-氧代吡啉-3-基或1-氧代-2-氯吡啉-5-基; R_1 为氢; R_2 为甲基; 且 R_3 为正丙基。

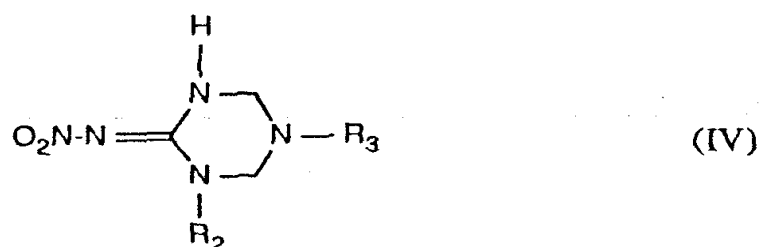
可通过例如下面的方法, 制备本发明式 I 化合物:

a) 将式 II 化合物与甲醛或仲甲醛以及式 III 化合物反应



或

b) 将式 IV 化合物与式 V 化合物反应



或

c) 当制备其中 R_1 不是氢的式 I 化合物时, 将所制备的其中 R_2 为氢的式 I 化合物与式 IV 化合物



并根据需要，将所产生的式 I 化合物按已知方法转化成其盐；式 II—VI 中 R_1 、 R_2 、 R_3 和 A 的定义同前，X 为卤素，Y 为离去基团。作为离去基团的 X 和 Y 的例子有卤素（氯、溴或碘较好）或磺酸残基（如烷基磺酸残基、甲磺酸酯或甲苯磺酸酯）。

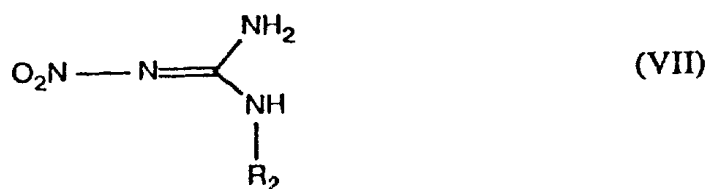
本发明方法中的方法 a) 在正常压力下于 0°C — 140°C （尤其是 $+20^{\circ}\text{C}$ — $+120^{\circ}\text{C}$ ）在惰性溶剂中进行有利，但也可在高压下进行。适宜的溶剂尤其是醇类（如甲醇、乙醇和丙醇）和水。其它适宜溶剂的例子有：芳香烃类，如苯、甲苯和二甲苯；醚类，如四氢呋喃、二噁烷和乙醚；卤代烃类，如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳和氯苯，以及不影响该反应的其它溶剂。也可使用混合溶剂。该反应也可在加入酸催化剂，如 HCl 、 H_2SO_4 或磺酸（如对甲苯磺酸）的情况下进行。反应所产生的水可根据需要通过利用水分离器或通过加入分子筛而除去。

上面所提到的方法 B) 和 C) 最好在正常压力或轻微加大的压力下于优选的非质子传递溶剂或稀释剂中进行。适宜的溶剂或稀释剂的例子有：醚和醚的化合物，如二乙醚、二丙醚、二丁醚、二噁烷、二甲氧乙烷和四氢呋喃；脂族、芳族或卤代烃，尤其是苯、甲苯、二甲苯、氯仿、二氯甲烷、四氯化碳和氯苯；腈类，如乙腈或丙腈；二甲基亚砷和二甲基甲酰胺。这两种方法一般在 -20 — $+140^{\circ}\text{C}$ （优选 0 — $+120^{\circ}\text{C}$ ）且优选在碱存在的情况下进行。适宜碱的例子是碳酸盐，如碳酸钠和碳酸钾。氢化物（如氢化钠、氢化钾和氢化钙）也可作为碱使用。

式 II、III、V 和 VI 的起始原料是已知的或可按与已知方法相似的方法制备。

从 EP 专利申请 3 7 5 9 0 7 和 3 7 6 2 7 9 可知作为式 II 起始原料的 2-硝基胍及其制备方法。式 III 的伯胺是市售产品。

本发明也涉及的式 IV 2-硝基亚氨基-1,3,5-三唑是通过式 VII 的 2-硝基胍与甲醛或仲甲醛以及式 III 化合物反应而制得的。



式 VII 和式 III 中的 R_2 和 R_3 的定义同前。该方法的反应条件与前面制备式 I 化合物的方法 a) 中的条件相同。除 2-硝基亚氨基-5-甲基-1,3,5-三氮杂环己烷 (EP 专利申请 0 3 8 6 5 6 5) 和 2-硝基亚氨基-1,3,5-三氮杂环己烷 (US-PS 4 9 3 7 3 4 0) 外, 式 N 化合物均是新的。式 VII 的硝基胍是已知的 (见 US-PS 4 8 0 4 7 8 0 和 4 2 2 1 8 0 2) 或可按相似的方式制备。

大量的式 V 化合物是已知的 (如见 EP 专利申请 3 7 5 9 0 7 和 3 7 6 2 7 9)。优选其中 X 为氯的式 V 化合物作为起始原料。

同样, 大量的式 VI 化合物是已知的。它们为市售产品或可通过已知方法很容易地制备。这些化合物中的离去基团 Y 最好为卤原子, 尤其是氯原子。

已知某些开链2-硝基胍衍生物具有杀虫活性(如见EP专利申请0375907和0376279)。然而,基于硝基胍结构的杀虫杂环化合物也是已知的。例如,EP专利申请0192060和0259738叙述了具有杀昆虫活性的2-硝基亚氨基嘧啶衍生物。而且,US-PS 4937340提出用2-硝基亚氨基-1,3,5-三氮杂环己烷及其它含有硝基的相应衍生物作为炸药的添加剂。EP专利申请0386565推荐了本发明类型的杀昆虫化合物,本发明式I化合物已被该EP专利申请权利要求的最宽范围所部分包括。

而令人惊奇的发现是,本发明式I的化合物是控制害虫的有用活性成分,且能够被温血动物、鱼和植物所耐受。本发明的化合物尤其适用于抵抗存在于有用植物和观赏植物上的昆虫,可应用于农业(尤其是棉花、蔬菜和水果作物)、林业以及保护储存货物和原材料,也可应用于卫生业,尤其是家畜和生产性家畜上。本发明化合物对付破坏植物的刺吸式口器害虫(尤其是蚜虫和蝉)尤其有效。它们对通常的敏感品系和抗性品系的各个发育阶段的害虫均能进行有效地防治,其作用表现为使害虫立即死亡或一定时期后(如蜕皮期)死亡、或产卵减少和/或孵化率降低。以上所提到的害虫包括:

鳞翅目昆虫,例如长翅卷叶蛾属数种、小卷叶蛾属数种、透翅蛾属数种、地老虎属数种、棉叶波纹夜蛾、Amylois属数种、黎豆夜蛾、黄卷蛾属数种、带卷蛾属数种、夜蛾、玉米楷夜蛾、粉斑螟、桃小食心虫、螟属数种、黄色卷蛾属数种、葡萄果蠹蛾、卷螟属数种、卷蛾属数种、Cochylis属数种、鞘蛾种、Crocidolomia binotalis、苹果异形小卷蛾、蠹蛾属数种、玉米螟属数种、展叶松夜蛾、金刚钻属数种、粉螟属数种、花小卷蛾属数种、

Eupoecilia ambiguella、毛虫属数种、根虫属数种、食心虫属数种、绿小卷叶蛾、夜蛾属数种、菜螟、美国白蛾、番茄蠹蛾、旋纹潜叶蛾、细蛾属数种、*Lobesia botrana*、毒蛾属数种、潜叶蛾属数种、天幕毛虫属数种、甘蓝夜蛾、烟草天蛾、尺蠖属数种、欧洲玉米螟、超小卷蛾属数种、褐卷叶蛾属数种、小眼夜蛾、红铃虫、马铃薯块茎蛾、菜粉蝶、粉蝶属数种、小菜蛾、巢蛾属数种、白野螟属数种、大螟属数种、长须卷蛾属数种、粘虫属数种、透翅蛾属数种、列行毛虫属数种、啃皮卷蛾属数种、粉纹夜蛾以及巢蛾属数种；

鞘翅目昆虫，如叩甲属数种、象甲属数种、*Atomaria linearis*、甜菜茎跳甲、谷象属数种、象甲属数种、皮蠹属数种、叶甲属数种、瓢虫属数种、*Eremnus* spp、马铃薯甲虫、稻象甲属数种、金龟属数种、谷盗属数种、象虫属数种、*Phlyctinus* spp、*Popillia* spp、跳甲属数种、蠹属数种、金龟子、米象属数种、麦蛾属数种、粉甲属数种、拟谷盗属数种、斑皮蠹属数种；

直翅目昆虫，如蜚蠊属数种、蠊属数种、蝼蛄属数种、马得拉蜚蠊、飞蝗属数种、大蠊属数种、蚱蜢属数种；

等翅目昆虫，如白蚁属数种；

啮虫目昆虫，如书虱属数种；

虱目昆虫，如盲虱属数种、顎虱属数种、头虱属数种、瘰棉蚜属数种、根瘤蚜属数种；

食毛目昆虫，如 *Damalinea* spp 和羽虱属数种；

缨翅目昆虫，如蓟马属数种、条蓟马属数种、带蓟马属数种、棕黄蓟马、棉蓟马和非洲桔梗蓟马；

异翅亚目昆虫，如臭虫属数种、可可瘤盲椿、红椿属数种、*Euchistus* spp、褐盾椿属数种、稻缘椿属数种、拟网椿属数种、甜菜拟网蝶、可可盲椿象、黑椿属数种和吸血猎椿属数种；

同翅目昆虫，如绵粉虱、*Aleyrodes brassicae*、圆红蚧属数种、蚜科、蚜属数种、圆蚧属数种、棉粉虱、蜡蚧属数种、茶褐圆蚧、蔷薇轮蚧、褐软蚧、微叶蝉属数种、苹果棉蚜、斑叶蝉属数种、*Gascardia* spp.、稻灰飞虱属数种、李蜡蚧、蛎蚧属数种、管蚜属数种、瘤额蚜属数种、黑尾叶蝉属数种、褐稻虱属数种、*Paratoria* spp.、瘤绵蚜属数种、桔粉蚧属数种、桑白蚧属数种、粉蚧属数种、木虱属数种、棉蚧、圆盾蚧属数种、缢管蚜属数种、盗蚧属数种、叶蝉属数种、麦二叉蚜属数种、*Sitobion* spp.、温室白粉虱、*Trioza erytreal* 和桔盾蚧；

膜翅目昆虫，如 *Acromyrmex*、得切叶属数种、蚁属数种、麦茎蜂、叶蜂属数种、锯角叶蜂科、云杉叶蜂、实叶蜂属数种、田蚁属数种、厨蚁、锯角叶蜂属数种、火蚁属数种和胡蜂属数种；

双翅目昆虫，如伊蚊属数种、*Antherigona soccata*、*Bilio hortulanus*、红头丽蝇、实蝇属数种、果蝇属数种、库蚊属数种、疽蝇科属数种、实蝇属数种、黄猩猩果蝇、腹厩蝇属数种、*Gastrophilus* spp.、舌蝇属数种、牛皮蝇属数种、*Hyppobosca* 种、潜蝇属数种、丝光绿蝇属数种、潜叶蝇属数种、家蝇属数种、鼻蝇属数种、*Orseolia* spp.、瑞典麦杆蝇、菠菜潜叶花蝇、春麦蝇属数种、苹果实蝇、尖眼蕈蚊属数种、螫蝇属数种、牛虻属数种、*Tannia* spp. 和大蚊属数种；

蚤目昆虫，如蚤种属数种、东方鼠蚤；

蜚蠊目昆虫，如粗脚粉螨、枯芽瘿螨、苹刺瘿螨、花蜚属数种、蜚属数种、须螨属数种、苜蓿苔螨属数种、*Calipitimerus* spp.、痒螨属数种、鸡皮刺螨、鹅耳枥东方叶螨、瘿螨属数种、缘璃眼蜚属数种 spp.、硬蜚属数种、*Olygonyehus pratensis*、喙蜚属数种、全爪螨属数种、桔锈螨、侧多食蛛线螨、痒螨属数种、扇头蜚属数种、根螨属数种、蚧螨属数种、线螨属数种和红叶螨属数种；以及

缨翅目昆虫，如西洋衣鱼。

本发明式 I 化合物的良好杀虫活性能够使至少 50—60% 以上的害虫致死。

通过加入其它杀虫剂和/或杀螨剂实际上可加大本发明化合物及含有这些化合物的组合物的活性并适应不同情况。适合于与之配伍使用的有以下各类化合物：有机磷类化合物，硝基苯酚类及其衍生物，甲脒类，脲类，氨基甲酸酯类，拟除虫菊酯类，氯代烃类和苏云金芽孢杆菌制剂。

式 I 化合物可不经修饰直接使用或最好与剂型加工技术中所通常使用的辅助剂结合后使用，因此可按已知方法将其配制成：可乳化浓缩物、可直接喷洒或稀释的溶液、稀释乳液、可湿性粉剂、可溶性粉剂、粉剂、颗粒剂以及聚合物中的胶囊剂。对于组合物，其施用的方法（如喷雾、雾化、撒粉、播撒或泼浇）依所期望达到的目的和具体情况而定。式 I 化合物也适用于处理种子。为此，既可在播种前用活性成分或含有活性成分的配方处理种子或作种子包衣，也可在播种时将活性成分施用于播种沟内。

可按已知方法制备配方，即含有式 I 化合物（活性成分）的组合物、制剂或混合物或这些化合物与其它杀虫剂或杀螨剂和适宜的固体或液体辅助剂的结合物。例如，通过将活性成分与添加剂（如溶剂）、固体载体以及适宜的表面活性化合物（表面活性剂）均匀混合和/或研磨而加工成制剂。

合适的溶剂是：芳香烃（ $C_8 - C_{12}$ 的烷基苯较好），如二甲苯混合物或烷基化的萘；脂族或环脂族烃，如环己烷、石蜡或四氢化萘；醇，如乙醇、丙醇或丁醇，以及二元醇及其醚或酯，如丙二醇、二丙二醇醚、乙二醇、乙二醇单甲基或单乙基醚；酮，如环己酮、异

佛尔酮或双丙酮醇；强极性溶剂，如N-甲基-2-吡咯烷酮、二甲基亚砷或二甲基甲酰胺；水；植物油，如菜油、蓖麻油、椰子油或黄豆油；合适的话，还包括砷油。

用于粉剂和可分散粉剂中的固体载体通常是天然无机填料，如方解石、滑石、高岭土、蒙脱土或美国活性白土。为了改善其物理性质，也可加入高度分散的硅酸或高度分散的吸附剂多聚物。合适的粒化吸附载体是多孔型载体，如浮石、碎砖、海泡石或膨润土；合适的非吸附性载体是方解石或砂子。另外，可使用各种无机或有机的粒化物质，尤其是例如白云石或粉碎的植物残渣。

根据所要配制的式I化合物的性质或这些化合物与其它杀虫剂或杀螨剂的组合物的性质，可适当地选择具有良好乳化、分散和湿润作用的非离子型、阳离子型和/或阴离子型表面活性剂。术语“表面活性剂”也应被理解为包括表面活性剂的混合物。

所谓的水溶性肥皂和水溶性合成表面活性化合物都是合适的阴离子型表面活性剂。

合适的皂是高级脂肪酸($C_{10} - C_{22}$)的碱金属盐、碱土金属盐、取代或未被取代的铵盐，如油酸或硬脂酸的钠盐或钾盐，或者是可得自椰子油或妥尔油的天然脂肪酸混合物的盐。还包括脂肪酸甲基牛磺酸盐。

但更常使用的是所谓的合成表面活性剂，尤其是脂肪磺酸盐、脂肪硫酸盐、磺化苯并咪唑衍生物或烷芳基磺酸盐。

脂肪磺酸盐或硫酸盐通常为碱金属盐、碱土金属盐或未取代或取代的铵盐，且含有 $C_8 - C_{22}$ 烷基（其中也包括酰基中的烷基部分），如木素磺酸、十二烷基硫酸或得自天然脂肪酸的脂肪醇硫酸混合物的钠盐或钙盐。这些化合物也包括硫酸化和磺化的脂肪醇/环氧乙烷加成物的盐。磺化苯并咪唑衍生物最好含有 2 个磺酸基团和一个含有约 8 - 12 个碳原子的脂肪酸残基。烷基磺酸盐的例子有十二烷基苯磺酸、双丁基萘磺酸或萘磺酸与甲醛的缩合物的钠盐、钙盐或三乙醇胺盐。还包括相应的磷酸盐，如对 - 壬基酚与 4 - 14 mol 环氧乙烷的加成物的磷酸酯的盐或磷脂的盐。

非离子表面活性剂最好是脂族或环脂族醇、饱和或不饱和脂肪酸以及烷基苯酚的聚乙二醇醚衍生物，该衍生物含有 3 - 30 个乙二醇醚基团和 8 - 20 个（脂族）烃中的碳原子以及 6 - 18 个烷基苯酚中烷基部分的碳原子。更合适的非离子表面活性剂是聚环氧乙烷与聚丙二醇、乙二胺聚丙二醇和烷基聚乙二醇（烷基链中含有 1 - 10 个碳原子）的水溶性加成物，该加成物含有 20 - 250 乙二醇醚基团和 10 - 100 个丙二醇醚基团。这些化合物常在每个丙二醇单元中含有 1 - 5 个乙二醇单元。

非离子表面活性剂的典型例子有壬基酚聚乙氧基乙醇、蓖麻油聚乙二醇醚、聚环氧丙烷/聚环氧乙烷加成物、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。聚氧乙烯山梨糖醇的脂肪酸酯（如聚氧乙烯山梨糖醇三油酸酯）也是合适的非离子表面活性剂。

优选的阳离子表面活性剂是含有至少一个作为 N -取代基的 $C_8 - C_{22}$ 烷基残基且含有进一步作为取代基的未取代或卤代低级烷基、苄

基或羟基—低级烷基残基的季铵盐。该盐最好是卤化物、甲基硫酸盐或乙基硫酸盐，如氯化硬脂酰三甲铵或溴化苄基二（2—氯乙基）乙铵。

在例如以下的出版物中叙述了剂型加工技术领域通常所使用的表面活性剂。

"McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publishing Corp., Glen Rock, NJ, USA, 1988",

H. Stache, "Tensid-Taschenbuch", 2nd edition, C. Hanser Verlag, Munich, Vienna, 1981,

M. and J. Ash, "Encyclopedia of Surfactants", Vol. I-III, Chemical Publishing Co., New York, 1980-1981.

杀虫组合物通常含有0.1—99%（优选0.1—95%）的式I化合物或它与其它杀虫剂或杀螨剂的混合物、1—99.9%的固体或液体辅助剂和0—25%（优选0.1—25%）的表面活性剂。最好将市售产品配制成浓缩物，而用户则通常使用活性成分浓度极低的稀释配方。通常的施用浓度为0.1—1000 ppm，优选0.1—500 ppm。施用量通常为每公顷1—1000克活性成分，25—500 g/ha 较好。

以下组合物是尤其优选的配方（全部按重量百分比计），其中活性成分意指式I化合物：

可乳化浓缩物：

活性成分：	1—90%，	优选5—20%
表面活性剂：	1—30%，	优选10—20%
液体载体：	5—94%，	优选70—85%

粉剂:

活性成分:	0.1 - 10 %,	优选 0.1 - 1 %
固体载体:	99.9 - 90 %,	优选 99.9 - 99 %

悬浮浓缩液:

活性成分:	5 - 75 %,	优选 10 - 50 %
水:	94 - 24 %,	优选 88 - 30 %
表面活性剂:	1 - 40 %,	优选 2 - 30 %

可湿性粉剂:

活性成分:	0.5 - 90 %,	优选 1 - 80 %
表面活性剂:	0.5 - 20 %,	优选 1 - 15 %
固体载体:	5 - 95 %,	优选 15 - 90 %

颗粒剂:

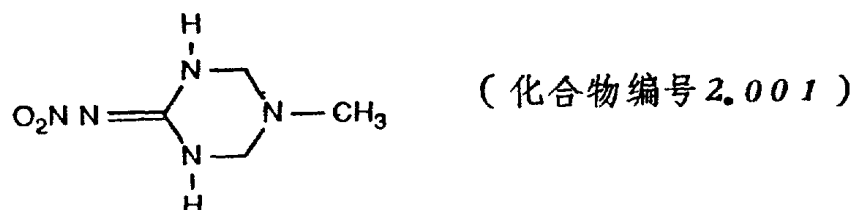
活性成分:	0.5 - 30 %,	优选 3 - 15 %
固体载体:	99.5 - 70 %,	优选 97 - 85 %

上述组合物也可进一步包括各种辅助剂,例如,植物油或环氧化植物油(环氧化椰子油、菜油或豆油)等稳定剂;消泡剂(如硅油);防腐剂;粘度调节剂;粘合剂;增粘剂以及肥料或用于获得特殊效果的其它活性成分。

以下实施例旨在说明本发明,但不限制本发明。

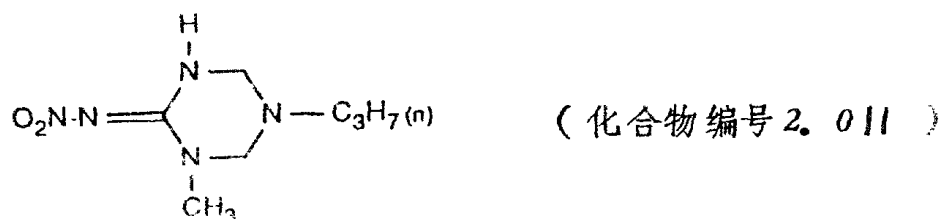
实施例 1 (式 N 起始物的制备)

- a) 制备 2-硝基亚氨基-5-甲基-1,3,5-三氮杂环己烷
- 于 50℃, 将 26.0 g 2-硝基胍、甲胺于乙醇中的 31.1 ml 3 M 溶液、38 ml 37% 甲醛水溶液和 100 ml 乙醇的混合物加热 2 小时, 然后过滤。滤出的晶体经用乙醇洗涤三次 (每次 20 ml 乙醇) 和干燥后得到标题化合物, m. p. 173-175℃, 其结构式为:



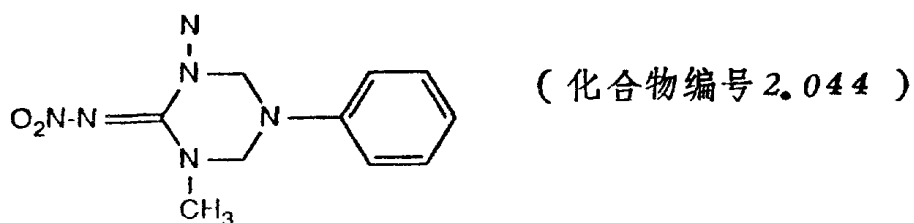
- b) 制备 1-甲基-2-硝基亚氨基-5-正丙基-1,3,5-三氮杂环己烷

将 17.1 g 1-甲基-2-硝基胍、12.0 ml 正丙胺、22.0 ml 37% 的甲醛水溶液以及 40 ml 乙醇的混合物于 50℃ 加热 4 小时, 然后再加入 7.0 ml 正丙胺和 13.0 ml 37% 甲醛水溶液。于 50℃ 搅拌 2 小时后, 通过真空蒸发浓缩反应混合物, 所分离出的晶体经用乙醚搅拌后产生 26.9 g 下式标题化合物, m. p. 84-86℃

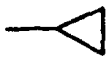
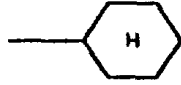
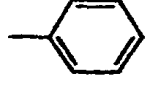
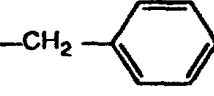
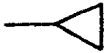
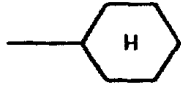
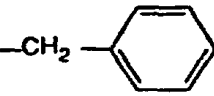


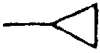
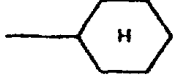
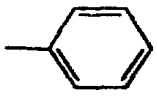
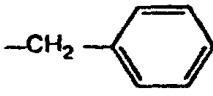
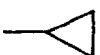
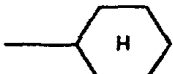
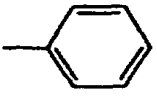
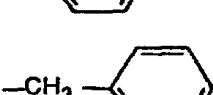
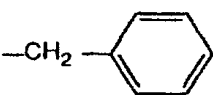
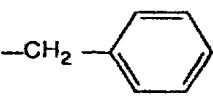
c) 制备 1-甲基-2-硝基亚氨基-5-苯基-1,3,5-三氮杂环己烷

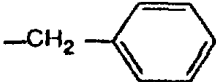
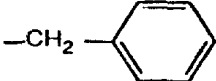
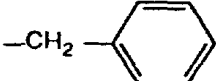
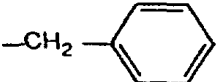
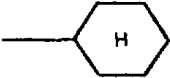
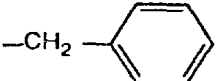
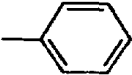
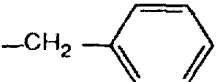
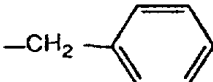
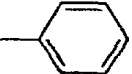
将 3 滴浓盐酸加到 23.6 g 1-甲基-2-硝基胍、2.11 ml 苯胺和 1.80 g 仲甲醛于 30 ml 甲苯中的混合物中，并将该混合物在水分离器中煮沸 6 小时。然后通过真空蒸发浓缩反应混合物，所产生的粗产物经甲醇重结晶后产生下式的标题化合物，m. p. 169 - 172

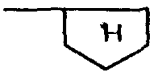
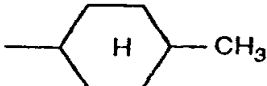
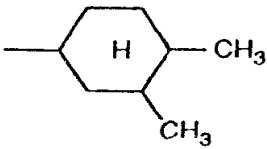
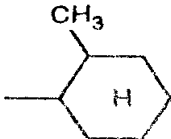


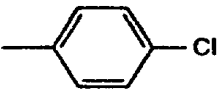
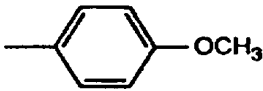
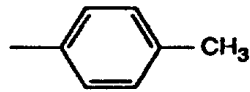
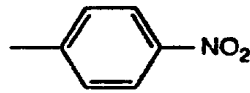
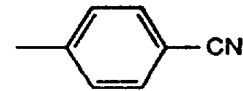
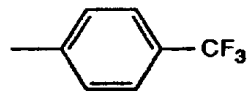
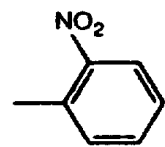
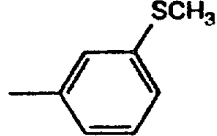
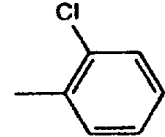
可按照上述方法制备以下式 IV 化合物：

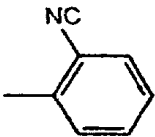
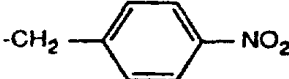
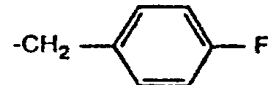
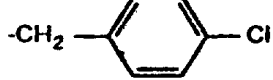
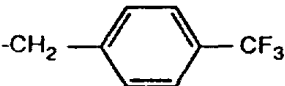
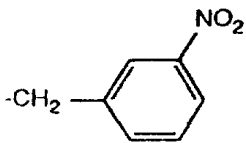
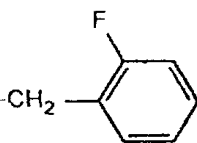
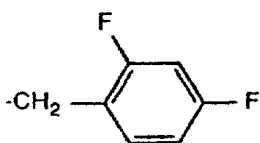
化合物号	R ₂	R ₃	物理参数
2.001	H	CH ₃	m.p. 173-175°C
2.002	H	-C ₂ H ₅	m.p. 181-182°C
2.003	H	-C ₃ H ₇ (n)	
2.004	H	CH(CH ₃) ₂	
2.005	H		m.p. 225-227°C
2.006	H		
2.007	H		
2.008	H	-CH ₂ - 	
2.009	CH ₃	-CH ₃	m.p. 134-135°C
2.010	CH ₃	-C ₂ H ₅	m.p. 112°C
2.011	CH ₃	-C ₃ H ₇ (n)	m.p. 84-86°C
2.012	CH ₃	-CH ₂ (CH ₃) ₂	m.p. 154°C
2.013	CH ₃		m.p. 177°C
2.014	CH ₃		m.p. 103-104°C
2.015	CH ₃	-C ₆ H ₅	m.p. 169-172°C
2.016	CH ₃	-CH ₂ - 	m.p. 161-163°C
2.017	-C ₂ H ₅	-CH ₃	
2.018	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	m.p. 95-96°C
2.019	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (n)	
2.020	-C ₂ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	

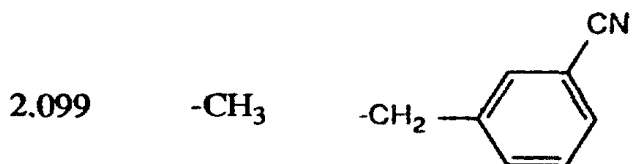
化合物号	R ₂	R ₃	物理参数
2.021	-C ₂ H ₅		
2.022	-C ₂ H ₅		
2.023	-C ₂ H ₅		
2.024	-C ₂ H ₅		
2.025		-CH ₃	
2.026		-C ₂ H ₅	m.p. 138-139°C
2.027		-C ₃ H ₇ (n)	
2.028		-CH(CH ₃) ₂	
2.029			
2.030			
2.031			
2.032			
2.033		-CH ₃	m.p. 109-111°C
2.034		-C ₂ H ₅	

化合物号	R ₂	R ₃	物理参数
2.035		-C ₃ H ₇ (n)	
2.036		CH(CH ₃) ₂	
2.037			
2.038			
2.039			
2.040			
2.041	H	-CH ₂ -COOCH ₃	
2.042	-CH ₃	-CH ₂ -COOCH ₃	
2.043		-CH ₂ -COOCH ₃	
2.044	-CH ₃		m.p. 169-172°C
2.045	-CH ₃	-CH ₂ CF ₃	
2.046	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ F	
2.047	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ Br	
2.048	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	
2.049	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br	
2.050	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ Cl	
2.051	-CH ₃	-CH ₂ CH(Cl)CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	
2.052	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	m.p. 121-123°C
2.053	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	
2.054	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	m.p. 81-83°C

化合物号	R ₂	R ₃	物理参数
2.055	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	
2.056	-CH ₃	-CH(CH ₃)CH ₂ OH	
2.057	-CH ₃	-CH(C ₂ H ₅)CH ₂ OH	
2.058	-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃)OH	
2.059	-CH ₃	-CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	
2.060	-CH ₃	-CH(CH ₂ OH) ₂	
2.061	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	
2.062	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	
2.063	-CH ₃	-CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	
2.064	-CH ₃	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	
2.065	-CH ₃	-CH ₂ CH(OC ₂ H ₅) ₂	
2.066	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	
2.067	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	
2.068	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	
2.069	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	
2.070	-CH ₃	-CH ₂ COOC ₂ H ₅	
2.071	-CH ₃	CH ₂ CH ₂ COOC ₂ H ₅	m.p. 110-112°C
2.072	-CH ₃	-CH(CH ₃)CH ₂ COOC ₂ H ₅	
2.073	-CH ₃	-CH(CH ₂ OH)COOCH ₃	
2.074	-CH ₃		
2.075	-CH ₃	 m.p. 151-153°C (顺式异构体) m.p. 138-140°C (反式异构体)	
2.076	-CH ₃		
2.077	-CH ₃		

化合物号	R ₂	R ₃	物理参数
2.078	-CH ₃	-CH ₂ -CH=CH ₂	m.p. 53-55°C
2.079	-CH ₃		
2.080	-CH ₃		m.p. 170-173°C
2.081	-CH ₃		m.p. 174-176°C
2.082	-CH ₃		m.p. 195-197°C
2.083	-CH ₃		m.p. 230°C
2.084	-CH ₃		m.p. 222-226°C
2.085	-CH ₃		m.p. 163-166°C
2.086	-CH ₃		
2.087	-CH ₃		
2.088	-CH ₃		

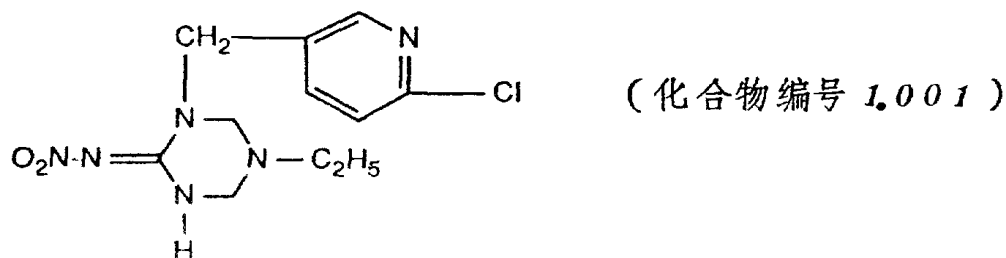
化合物号	R ₂	R ₃	物理参数
2.089	-CH ₃		
2.090	-CH ₃		m.p. 235-238°C
2.091	-CH ₃		m.p. 143-145°C
2.092	-CH ₃		m.p. 132-134°C
2.093	-CH ₃		m.p. 160-162°C
2.094	-CH ₃		m.p. 161-163°C
2.095	-CH ₃		m.p. 160-162°C
2.096	-CH ₃		
2.097	-CH ₃		
2.098	-CH ₃		



实施例 2

a) 制备 1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-2-硝基亚氨基-5-乙基-1,3,5-三氮杂环己烷

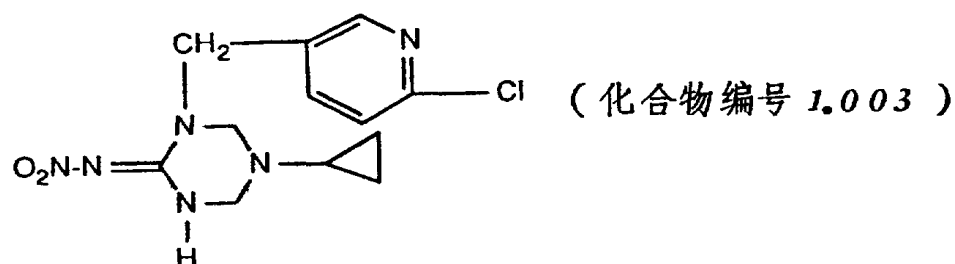
将 1.15 g 1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-2-硝基胍、0.75 ml 37% 的甲醛水溶液、0.32 ml 70% 的乙胺水溶液以及 5 ml 乙醇的混合物于 50℃ 加热 4 小时。然后通过真空蒸发浓缩反应混合物，残渣悬浮于 20 ml 乙醇，过滤所产生的晶体后得到下式的标题化合物，m. p. 125-126℃，



b) 制备 1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-2-硝基亚氨基-5-环丙基-1,3,5-三氮杂环己烷

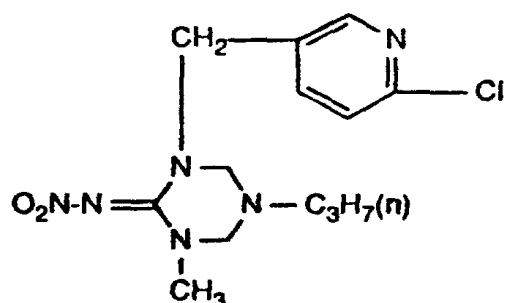
将 2.96 g 2-硝基亚氨基-5-环丙基-1,3,5-三氮

杂环己烷、2.59 g 2-氯-5-氯甲基吡啶和2.43 g 碳酸钾于60 ml 乙腈中的混合物回流加热16小时。过滤所产生的反应混合物，滤液通过真空蒸发浓缩，所形成的残余物经硅胶层析（二氯甲烷/乙酸乙酯，1:1）后产生下式的标题化合物，m. p. 125-127℃，



c) 制备 1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-2-硝基亚氨基-3-甲基-5-正丙基-1,3,5-三氮杂环己烷

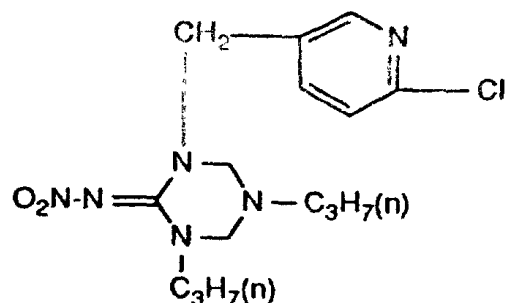
将20.1 g 1-甲基-2-硝基亚氨基-5-正丙基-1,3,5-三氮杂环己烷、16.2 g 2-氯-5-氯甲基吡啶、0.17 g 氯化铯和27.7 g 碳酸钾于150 ml DMF（二甲基甲酰胺）中的混合物于110℃加热9小时，然后在硅藻土上过滤。通过真空蒸发浓缩滤液，将所产生的粗产物溶于200 ml 二氯甲烷并用100 ml 水和100 ml 饱和氯化钠溶液洗涤。经硫酸镁干燥后通过蒸发浓缩。残余物经用乙酸乙酯重结晶后产生下式的标题化合物，m. p. 137-138℃，



(化合物编号 1.009)

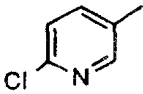
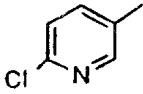
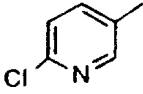
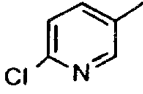
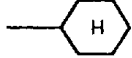
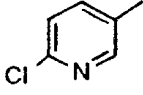
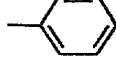
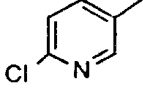
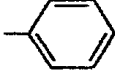
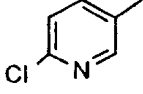
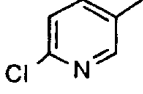
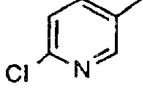
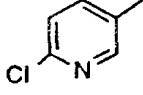
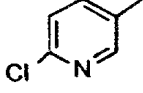
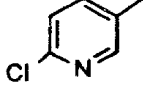
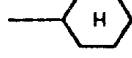
d) 制备 1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-2-硝基亚氨基-3,5-二-(正丙基)-1,3,5-三氮杂环己烷

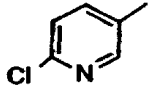
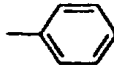
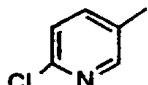
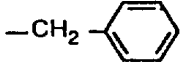
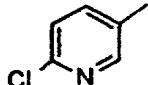
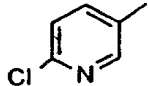
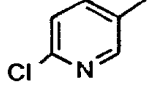
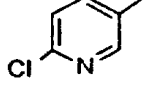
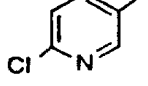
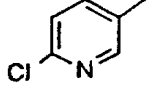
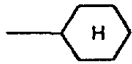
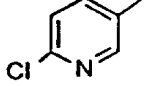
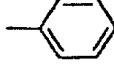
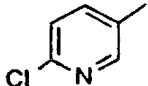
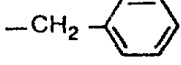
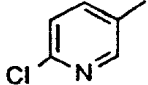
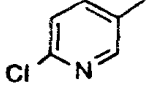
将 0.30 g 氢氧化钠 (80% 于白油中) 加到 3.12 g 1-(2-氯吡啶-5-基甲基)-2-硝基亚氨基-5-正丙基-1,3,5-三氮杂环己烷的 50 ml 乙腈溶液中。于室温下搅拌反应混合物 3 小时后加入 1.8 ml 正丙基碘，再将反应混合物于室温下搅拌 16 小时及于 80℃ 搅拌 2 小时。经真空蒸发后得到的残余物加到 100 ml 乙酸乙酯中，用 50 ml 饱和氯化钠溶液洗涤，硫酸镁干燥，并再次蒸发浓缩。作为残渣得到的晶体经于 0℃ 用乙酸乙酯重结晶后产生下式的标题化合物，m. p. 112-113℃，

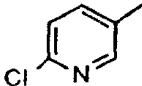
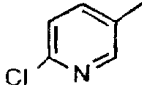
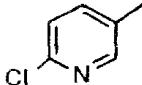
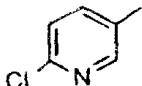
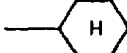
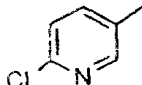
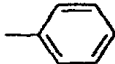
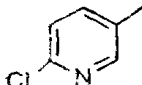
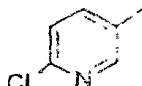
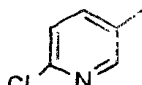
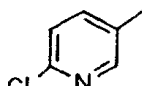
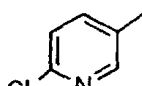
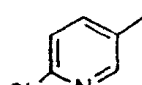
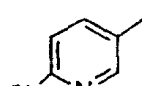
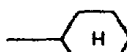


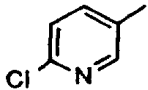
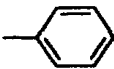
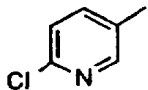
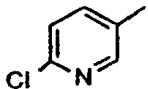
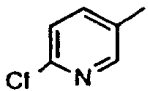
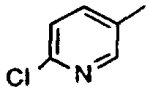
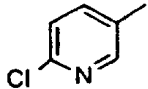
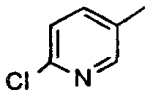
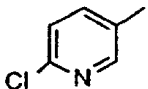
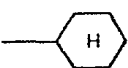
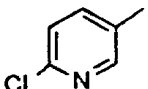
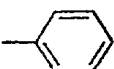
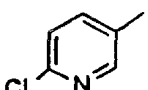
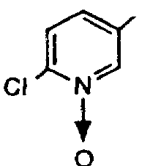
(化合物编号 1.025)

可按以上所述方法制备以下化合物：

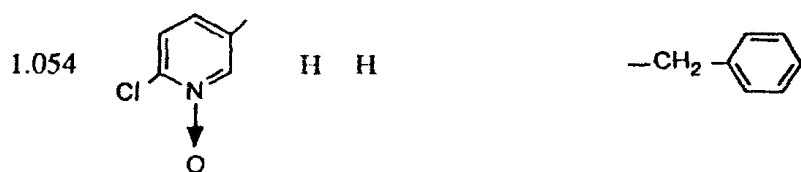
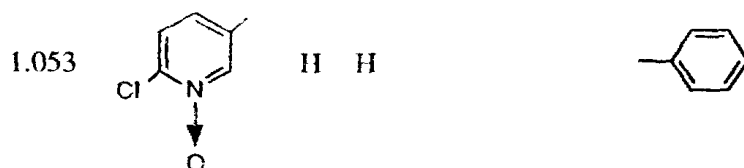
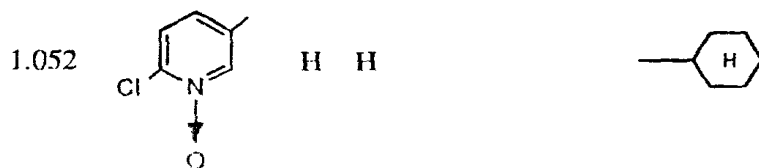
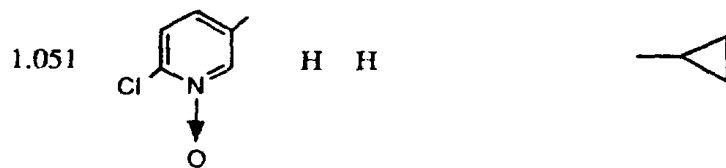
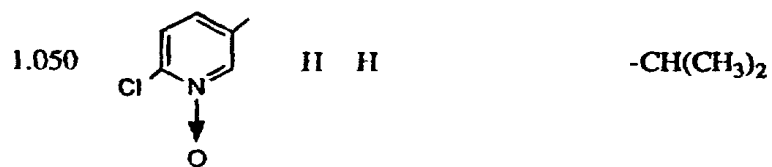
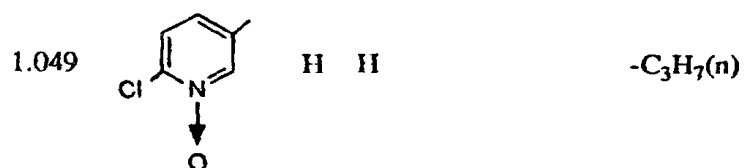
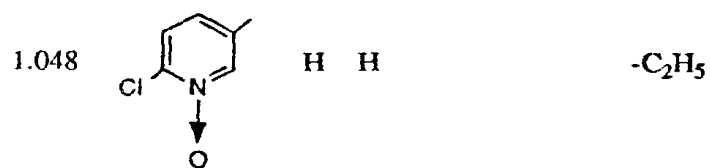
化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
1.001		H	H	-C ₂ H ₅	m.p. 125-126°C
1.002		H	H	-C ₃ H ₇ (n)	m.p. 115-117°C
1.003		H	H		m.p. 125-127°C
1.004		H	H		m.p. 150-151°C
1.005		H	H		m.p. 143-145°C
1.006		H	H	-CH ₂ - 	m.p. 108-110°C
1.007		H	CH ₃	-CH ₃	amorphous mass
1.008		H	CH ₃	-C ₂ H ₅	m.p. 124-125°C
1.009		H	CH ₃	-C ₃ H ₇ (n)	m.p. 137-138°C
1.010		H	CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	
1.011		H	-CH ₃		m.p. 104-106°C
1.012		H	-CH ₃		m.p. 146-147°C

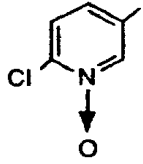
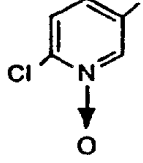
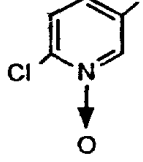
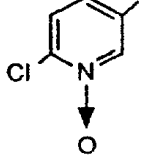
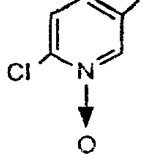
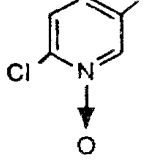
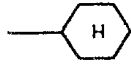
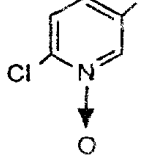
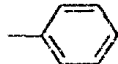
化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
1.013		H	-CH ₃		m.p. 146-149°C
1.014		H	-CH ₃		m.p. 116-118°C
1.015		H	-C ₂ H ₅	-CH ₃	
1.016		H	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CH ₃	m.p. 113-114°C
1.017		H	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (n)	
1.018		H	-C ₂ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	
1.019		H	-C ₂ H ₅		
1.020		H	-C ₂ H ₅		
1.021		H	-C ₂ H ₅		
1.022		H	-C ₂ H ₅		
1.023		H	-C ₃ H ₇ (n)	-CH ₃	
1.024		H	-C ₃ H ₇ (n)	C ₂ H ₅	

化合物号 A		R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
1.025		H	-C ₃ H ₇ (n)	-C ₃ H ₇ (n)	m.p. 112-113°C
1.026		H	-C ₃ H ₇ (n)	-CH(CH ₃) ₂	
1.027		H	-C ₃ H ₇ (n)		
1.028		H	-C ₃ H ₇ (n)		
1.029		H	-C ₃ H ₇ (n)		
1.030		H	-C ₃ H ₇ (n)	-CH ₂ - 	
1.031		H	-CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	
1.032		H	-CH(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	
1.033		H	-CH(CH ₃) ₂	-C ₃ H ₇ (n)	
1.034		H	-CH(CH ₃) ₂	-CH(CH ₃) ₂	
1.035		H	-CH(CH ₃) ₂		
1.036		H	-CH(CH ₃) ₂		

化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
1.037		H	-CH(CH ₃) ₂		
1.038		H	-CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ - 	
1.039		H		CH ₃	
1.040		H		-C ₂ H ₅	m.p. 115-116°C
1.041		H		-C ₃ H ₇ (n)	
1.042		H		-CH(CH ₃) ₂	
1.043		H			
1.044		H			
1.045		H			
1.046		H		-CH ₂ - 	
1.047		H	H	-CH ₃	

化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
------	---	----------------	----------------	----------------	------

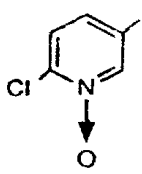
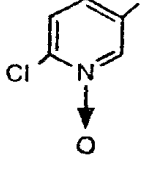
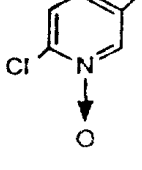
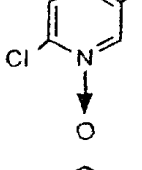
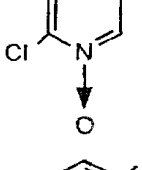
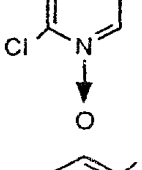
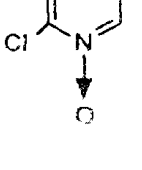
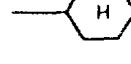


化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
1.055		H	CH ₃	-CH ₃	
1.056		H	CH ₃	-C ₂ H ₅	m.p. 152-155°C
1.057		H	CH ₃	-C ₃ H ₇ (n)	m.p. 117-121°C
1.058		H	CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	m.p. 138°C
1.059		H	CH ₃		
1.060		H	CH ₃		m.p. 153°C
1.061		H	CH ₃		

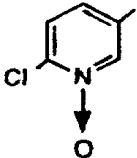
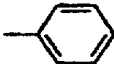
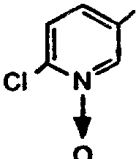
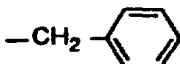
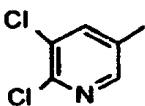
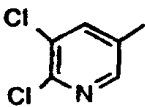
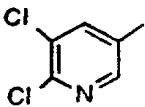
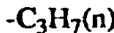
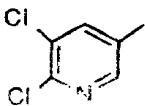
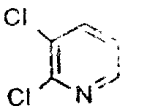
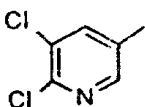
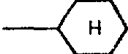
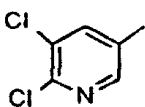
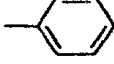
化合物号 A

R₁ R₂R₃

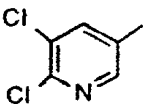
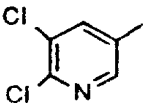
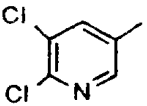
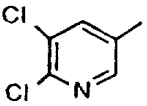
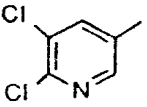
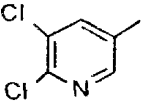
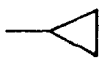
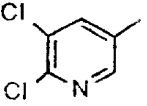
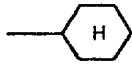
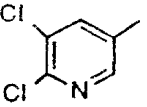
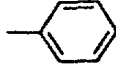
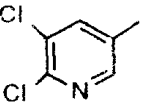
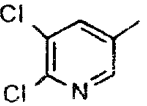
物理参数

1.062		H	CH ₃	-CH ₂ - 
1.063		H		-CH ₃
1.064		H		-C ₂ H ₅
1.065		H		-C ₃ H ₇ (n)
1.066		H		-CH(CH ₃) ₂
1.067		H		
1.068		H		

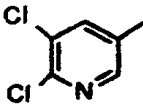
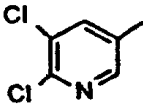
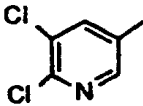
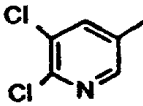
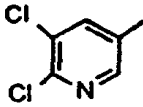
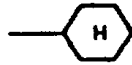
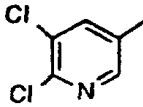
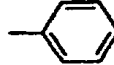
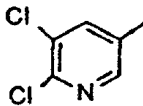
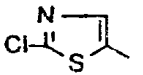
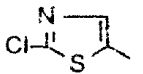
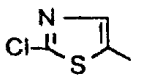
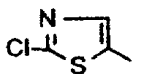
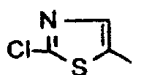
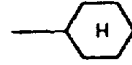
化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
------	---	----------------	----------------	----------------	------

1.069		H			
1.070		H			
1.071		H	H		
1.072		H	H		
1.073		H	H		
1.074		H	H		
1.075		H	H		
1.076		H	H		
1.077		H	H		

化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
------	---	----------------	----------------	----------------	------

1.078		H	H	$-\text{CH}_2-$ 
1.079		H	CH ₃	-CH ₃
1.080		H	CH ₃	-C ₂ H ₅
1.081		H	CH ₃	-C ₃ H _{7(n)}
1.082		H	CH ₃	-CH(CH ₃) ₂
1.083		H	CH ₃	
1.084		H	CH ₃	
1.085		H	CH ₃	
1.086		H	CH ₃	$-\text{CH}_2-$ 
1.087		H		-CH ₃

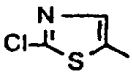
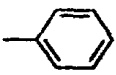
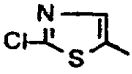
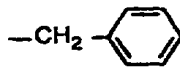
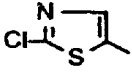
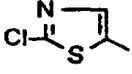
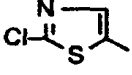
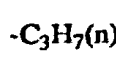
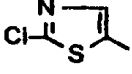
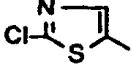
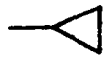
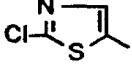
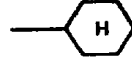
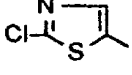
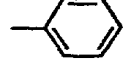
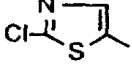
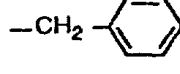
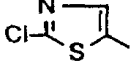
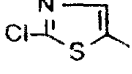
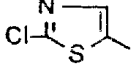
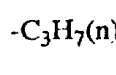
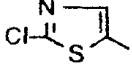
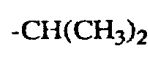
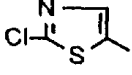
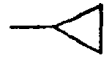
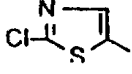
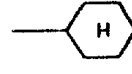
化合物号 A R₁ R₂ R₃ 物理参数

1.088		H		-C ₂ H ₅
1.089		H		-C ₃ H ₇ (n)
1.090		H		-CH(CH ₃) ₂
1.091		H		
1.092		H		
1.093		H		
1.094		H		-CH ₂ - 
1.095		H	H	-C ₂ H ₅
1.096		H	H	-C ₃ H ₇ (n)
1.097		H	H	-CH(CH ₃) ₂
1.098		H	H	
1.099		H	H	

化合物号 A

R₁ R₂R₃

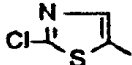
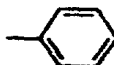
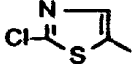
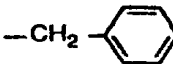
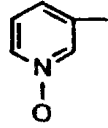
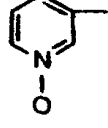
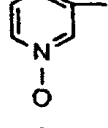
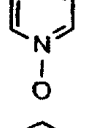
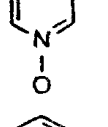
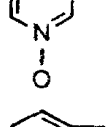
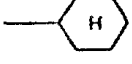
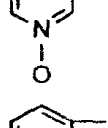
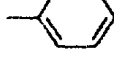
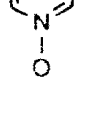
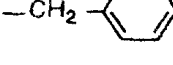
物理参数

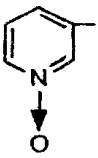
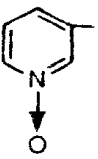
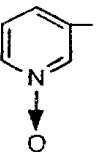
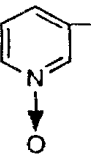
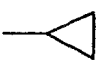
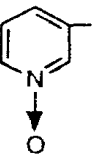
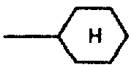
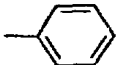
1.100		H	H		
1.101		H	H		
1.102		H	CH ₃		
1.103		H	CH ₃		
1.104		H	CH ₃		无定型
1.105		H	CH ₃		
1.106		H	CH ₃		
1.107		H	CH ₃		
1.108		H	CH ₃		
1.109		H	CH ₃		
1.110		H			
1.111		H			
1.112		H			
1.113		H			
1.114		H			
1.115		H			

化合物号 A

R₁ R₂R₃

物理参数

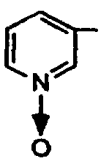
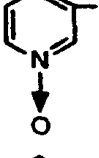
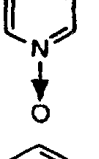
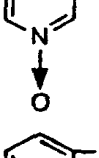
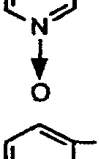
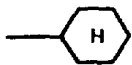
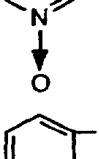
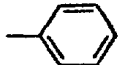
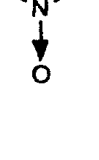
1.116		H		
1.117		H		
1.118		H	H	-CH ₃
1.119		H	H	-C ₂ H ₅
1.120		H	H	-C ₃ H ₇ (n)
1.121		H	H	-CH(CH ₃) ₂
1.122		H	H	
1.123		H	H	
1.124		H	H	
1.125		H	H	

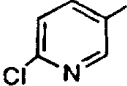
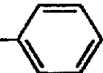
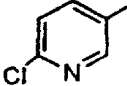
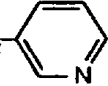
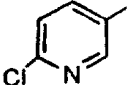
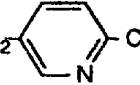
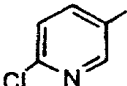
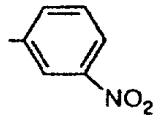
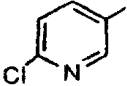
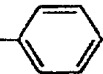
化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
1.126		H	H	-CH ₃	
1.127		H	CH ₃	-C ₂ H ₅	
1.128		H	CH ₃	-C ₃ H ₇ (n)	无定型物质
1.129		H	CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	
1.130		H	CH ₃		m.p. 185°C
1.131		H	CH ₃		
1.132		H	CH ₃		
1.133		H	CH ₃	-CH ₂ - 	

化合物号 A

R₁ R₂R₃

物理参数

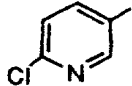
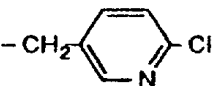
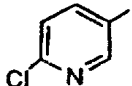
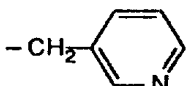
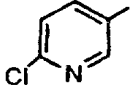
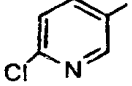
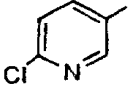
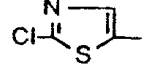
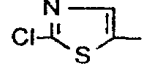
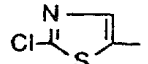
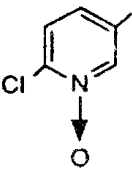
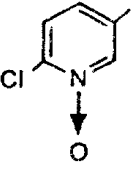
1.134		H		-CH ₃
1.135		H		-C ₂ H ₅
1.136		H		-C ₃ H _{7(n)}
1.137		H		-CH(CH ₃) ₂
1.138		H		
1.139		H		
1.140		H		
1.141		H		-CH ₂ - 

化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
1.142		H	H	-CH ₃	m.p. 142-144°C
1.143		H	-CH ₃	-CH ₃	
1.144		H		-CH ₃	
1.145		H	H	-C ₂ H ₅	
1.146		H	-CH ₃	-C ₂ H ₅	
1.147		H		-C ₂ H ₅	
1.148		H	-CH ₂ - 	-C ₃ H ₇ (n)	m.p. 127-129°C
1.149		H	-CH ₂ - 	-C ₃ H ₇ (n)	
1.150		H	-CH ₂ - 	-C ₃ H ₇ (n)	
1.151		H	-CH ₂ - 	-C ₃ H ₇ (n)	
1.152		H	-CH ₂ - 		

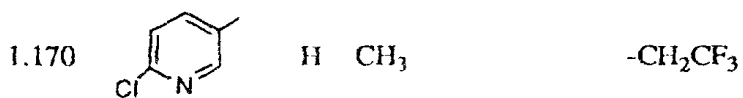
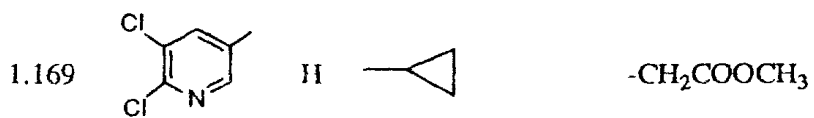
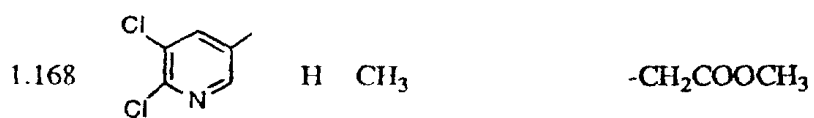
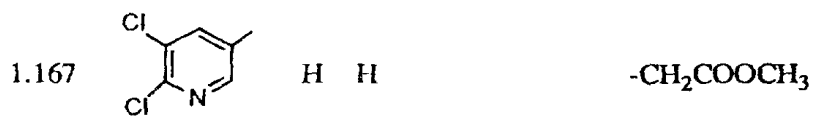
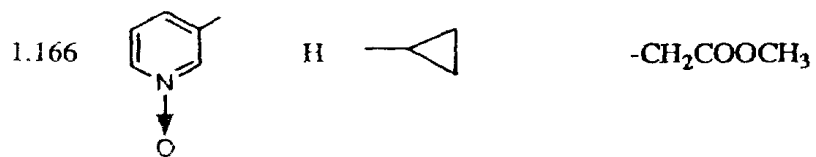
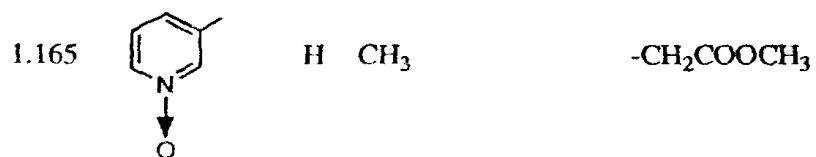
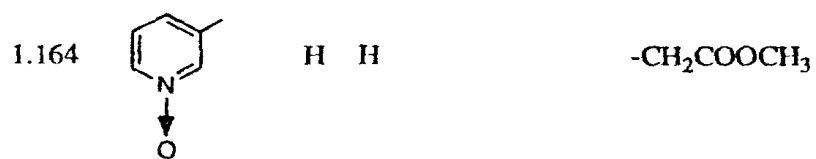
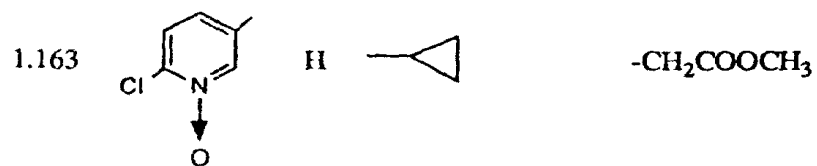
化合物号 A

R₁ R₂R₃

物理参数

1.153		H			m.p. 190-192°C
1.154		H			
1.155		H	H	-CH ₂ COOCH ₃	m.p. 184-186°C
1.156		H	CH ₃	-CH ₂ COOCH ₃	m.p. 185°C
1.157		H		-CH ₂ COOCH ₃	
1.158		H	H	-CH ₂ COOCH ₃	
1.159		H	CH ₃	-CH ₂ COOCH ₃	
1.160		H		-CH ₂ COOCH ₃	
1.161		H	H	-CH ₂ COOCH ₃	
1.162		H	CH ₃	-CH ₂ COOCH ₃	

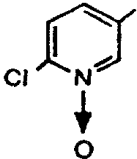
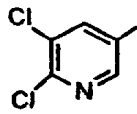
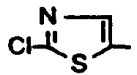
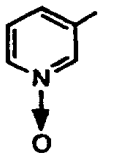
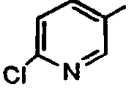
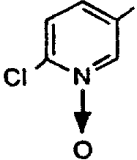
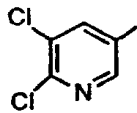
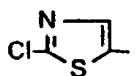
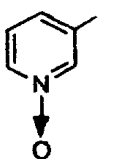
化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
------	---	----------------	----------------	----------------	------



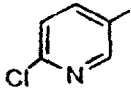
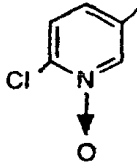
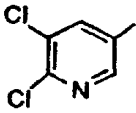
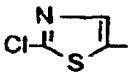
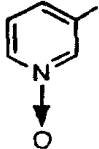
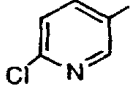
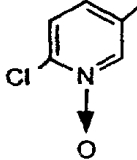
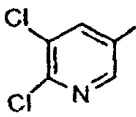
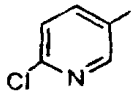
化合物号 A

R₁ R₂R₃

物理参数

1.171		H	CH ₃	-CH ₂ CF ₃
1.172		H	CH ₃	-CH ₂ CF ₃
1.173		H	CH ₃	-CH ₂ CF ₃
1.174		H	CH ₃	-CH ₂ CF ₃
1.175		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ F
1.176		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ F
1.177		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ F
1.178		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ F
1.179		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ F

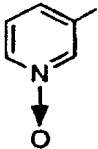
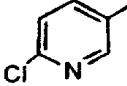
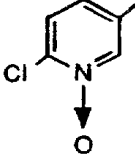
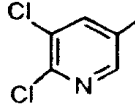
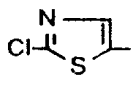
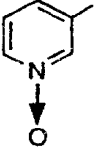
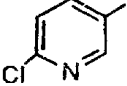
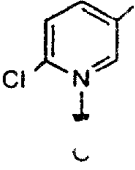
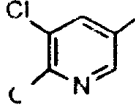
化合物号 A	R ₁ R ₂	R ₃	物理参数
--------	-------------------------------	----------------	------

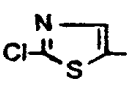
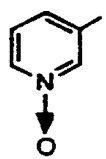
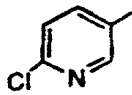
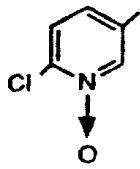
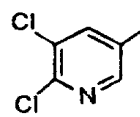
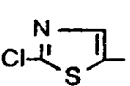
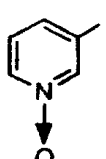
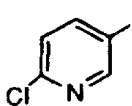
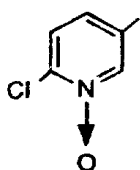
1.180		H CH ₃	-CH ₂ CH ₂ Br
1.181		H CH ₃	-CH ₂ CH ₂ Br
1.182		H CH ₃	-CH ₂ CH ₂ Br
1.183		H CH ₃	-CH ₂ CH ₂ Br
1.184		H CH ₃	-CH ₂ CH ₂ Br
1.185		H CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
1.186		H CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
1.187		H CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
1.188		H CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl

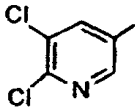
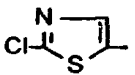
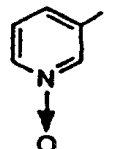
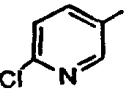
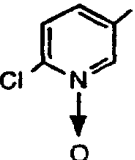
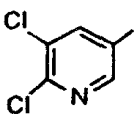
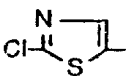
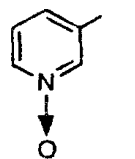
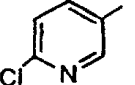
化合物号 A

R₁ R₂R₃

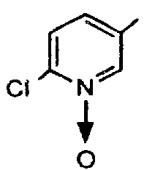
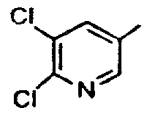
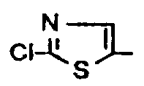
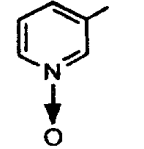
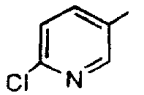
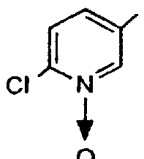
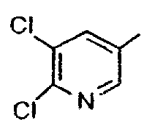
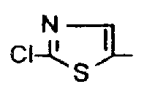
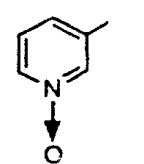
物理参数

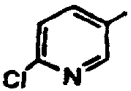
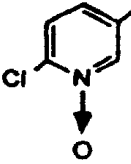
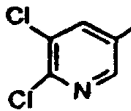
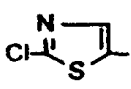
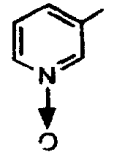
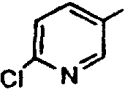
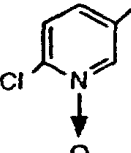
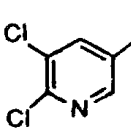
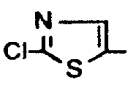
1.189		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
1.190		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br
1.191		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br
1.192		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br
1.193		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br
1.194		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ Br
1.195		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ Cl
1.196		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ Cl
1.197		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ Cl

化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
1.198		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ Cl	
1.199		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ Cl	
1.200		H	CH ₃	-CH ₂ CH(Cl)CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	
1.201		H	CH ₃	-CH ₂ CH(Cl)CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	
1.202		H	CH ₃	-CH ₂ CH(Cl)CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	
1.203		H	CH ₃	-CH ₂ CH(Cl)CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	
1.204		H	CH ₃	-CH ₂ CH(Cl)CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	
1.205		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	无定型物质
1.206		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	

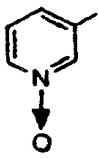
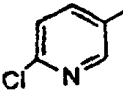
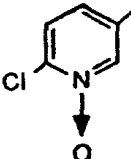
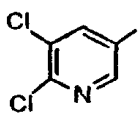
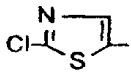
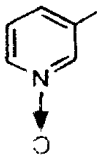
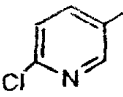
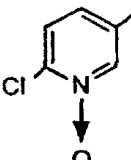
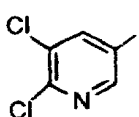
化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
1.207		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	
1.208		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	
1.209		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	
1.210		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	无定型物质
1.211		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	
1.212		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	
1.213		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	
1.214		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	
1.215		H	CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ OH	m.p. 108-110°C

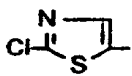
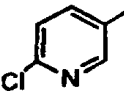
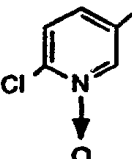
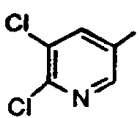
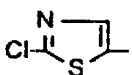
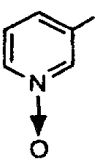
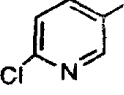
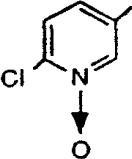
化合物号	Λ	R_1	R_2	R_3	物理参数
------	-----------	-------	-------	-------	------

1.216		H	CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ OH
1.217		H	CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ OH
1.218		H	CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ OH
1.219		H	CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ OH
1.220		H	CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ OH
1.221		H	CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ OH
1.222		H	CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ OH
1.223		H	CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ OH
1.224		H	CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ OH

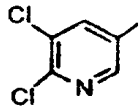
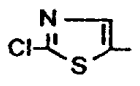
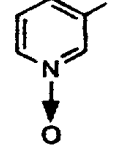
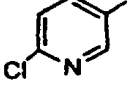
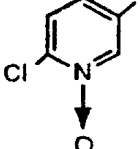
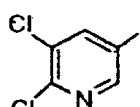
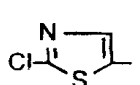
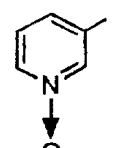
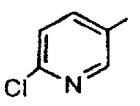
化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
1.225		H	CH ₃	-CH(CH ₃)CH ₂ OH	无定型物质
1.226		H	CH ₃	-CH(CH ₃)CH ₂ OH	
1.227		H	CH ₃	-CH(CH ₃)CH ₂ OH	
1.228		H	CH ₃	-CH(CH ₃)CH ₂ OH	
1.229		H	CH ₃	-CH(CH ₃)CH ₂ OH	
1.230		H	CH ₃	-CH(C ₂ H ₅)CH ₂ OH	
1.231		H	CH ₃	-CH(C ₂ H ₅)CH ₂ OH	
1.232		H	CH ₃	-CH(C ₂ H ₅)CH ₂ OH	
1.233		H	CH ₃	-CH(C ₂ H ₅)CH ₂ OH	

化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
------	---	----------------	----------------	----------------	------

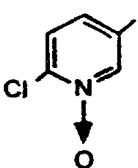
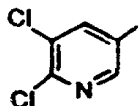
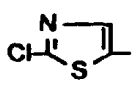
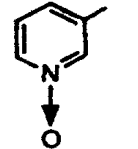
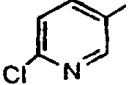
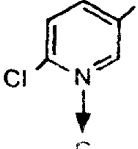
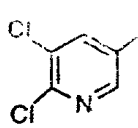
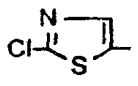
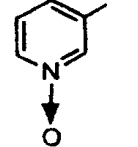
1.234		H	CH ₃	-CH(C ₂ H ₅)CH ₂ OH	
1.235		H	CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃)OH	
1.236		H	CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃)OH	
1.237		H	CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃)OH	
1.238		H	CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃)OH	
1.239		H	CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃)OH	
1.240		H	CH ₃	-CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	
1.241		H	CH ₃	-CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	
1.242		H	CH ₃	-CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	

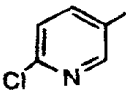
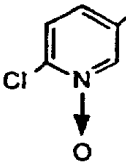
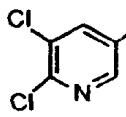
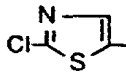
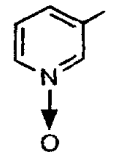
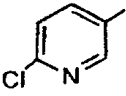
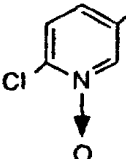
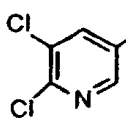
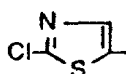
化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
1.243		H	CH ₃	-CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	
1.244		H	CH ₃	-CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	
1.245		H	CH ₃	-CH(CH ₂ OH) ₂	
1.246		H	CH ₃	-CH(CH ₂ OH) ₂	
1.247		H	CH ₃	-CH(CH ₂ OH) ₂	
1.248		H	CH ₃	-CH(CH ₂ OH) ₂	
1.249		H	CH ₃	-CH(CH ₂ OH) ₂	
1.250		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	
1.251		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	

化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
------	---	----------------	----------------	----------------	------

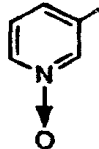
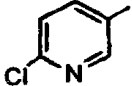
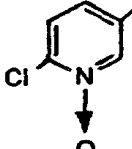
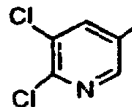
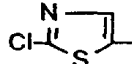
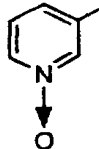
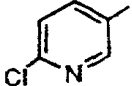
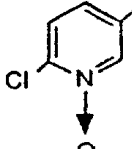
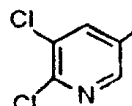
1.252		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	
1.253		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	
1.254		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	
1.255		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	
1.256		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	
1.257		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	
1.258		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	
1.259		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	
1.260		H	CH ₃	-CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	

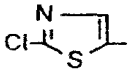
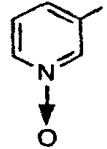
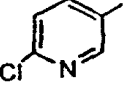
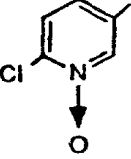
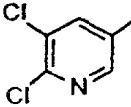
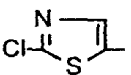
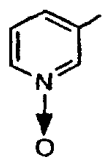
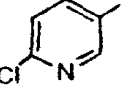
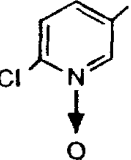
化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
------	---	----------------	----------------	----------------	------

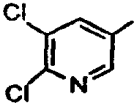
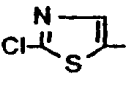
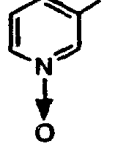
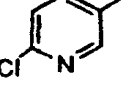
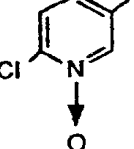
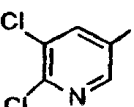
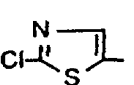
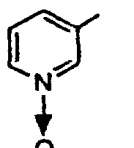
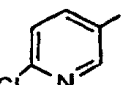
1.261		H	CH ₃	-CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	
1.262		H	CH ₃	-CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	
1.263		H	CH ₃	-CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	
1.264		H	CH ₃	-CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	
1.265		H	CH ₃	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	
1.266		H	CH ₃	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	
1.267		H	CH ₃	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	
1.268		H	CH ₃	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	
1.269		H	CH ₃	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	

化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
1.270		H	CH ₃	-CH ₂ CH(OC ₂ H ₅) ₂	
1.271		H	CH ₃	-CH ₂ CH(OC ₂ H ₅) ₂	
1.272		H	CH ₃	-CH ₂ CH(OC ₂ H ₅) ₂	
1.273		H	CH ₃	-CH ₂ CH(OC ₂ H ₅) ₂	
1.274		H	CH ₃	-CH ₂ CH(OC ₂ H ₅) ₂	
1.275		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	
1.276		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	
1.277		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	
1.278		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	

化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
------	---	----------------	----------------	----------------	------

1.279		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	
1.280		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	
1.281		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	
1.282		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	
1.283		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	
1.284		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	
1.285		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	
1.286		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	
1.287		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	

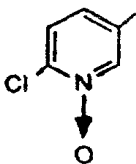
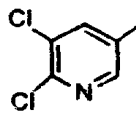
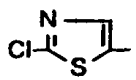
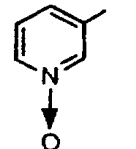
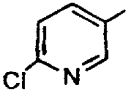
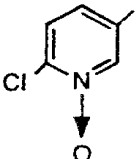
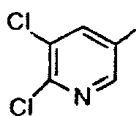
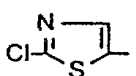
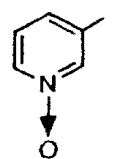
化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
1.288		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	
1.289		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	
1.290		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	
1.291		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	
1.292		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	
1.293		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	
1.294		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	
1.295		H	CH ₃	-CH ₂ COOC ₂ H ₅	无定型物质
1.296		H	CH ₃	-CH ₂ COOC ₂ H ₅	

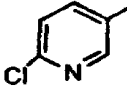
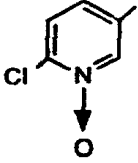
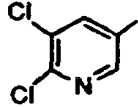
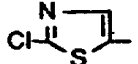
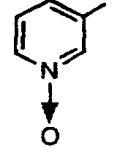
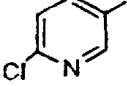
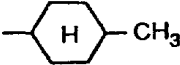
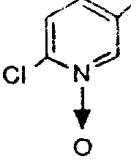
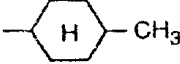
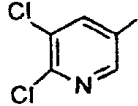
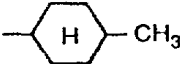
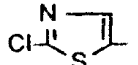
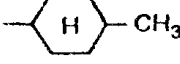
化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
1.297		H	CH ₃	-CH ₂ COOC ₂ H ₅	
1.298		H	CH ₃	-CH ₂ COOC ₂ H ₅	
1.299		H	CH ₃	-CH ₂ COOC ₂ H ₅	
1.300		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ COOC ₂ H ₅	m.p. 78-80°C
1.301		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ COOC ₂ H ₅	
1.302		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ COOC ₂ H ₅	
1.303		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ COOC ₂ H ₅	
1.304		H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ COOC ₂ H ₅	
1.305		H	CH ₃	-CH(CH ₃)CH ₂ COOC ₂ H ₅	

化合物号 A

 R_1 R_2 R_3

物理参数

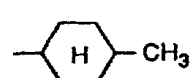
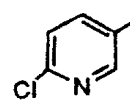
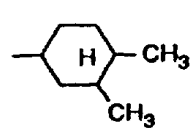
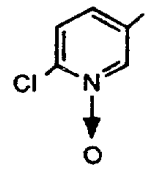
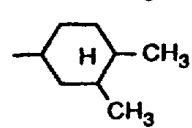
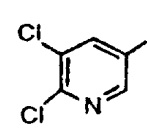
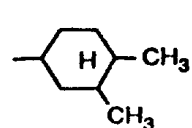
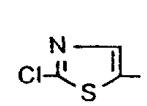
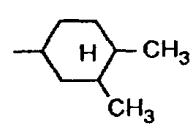
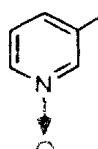
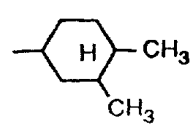
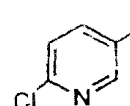
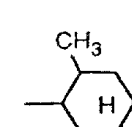
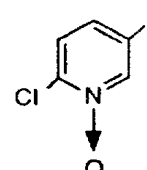
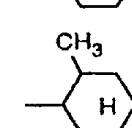
1.306		H	CH ₃	-CH(CH ₃)CH ₂ COOC ₂ H ₅
1.307		H	CH ₃	-CH(CH ₃)CH ₂ COOC ₂ H ₅
1.308		H	CH ₃	-CH(CH ₃)CH ₂ COOC ₂ H ₅
1.309		H	CH ₃	-CH(CH ₃)CH ₂ COOC ₂ H ₅
1.310		H	CH ₃	-CH(CH ₂ OH)COOCH ₃
1.311		H	CH ₃	-CH(CH ₂ OH)COOCH ₃
1.312		H	CH ₃	-CH(CH ₂ OH)COOCH ₃
1.313		H	CH ₃	-CH(CH ₂ OH)COOCH ₃
1.314		H	CH ₃	-CH(CH ₂ OH)COOCH ₃

化合物号 A		R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
1.315		H	CH ₃		
1.316		H	CH ₃		
1.317		H	CH ₃		
1.318		H	CH ₃		
1.319		H	CH ₃		
1.320		H	CH ₃		m.p. 137-139°C (顺式异构体) m.p. 170-172°C (反式异构体)
1.321		H	CH ₃		
1.322		H	CH ₃		
1.323		H	CH ₃		

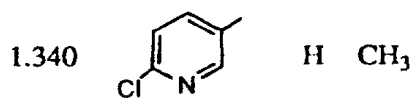
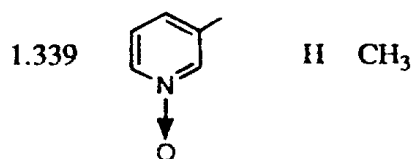
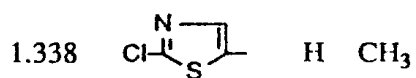
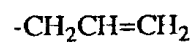
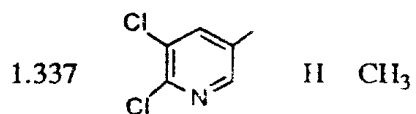
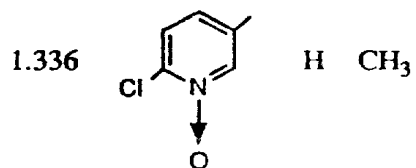
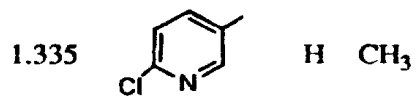
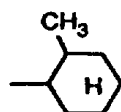
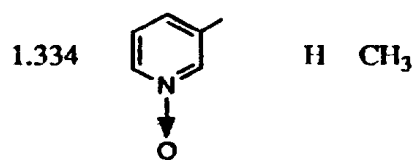
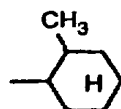
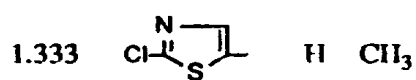
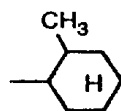
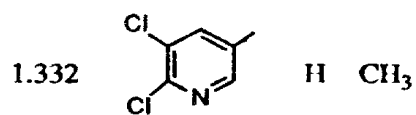
化合物号 A

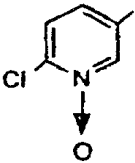
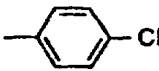
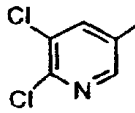
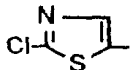
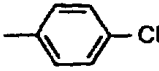
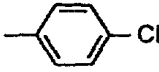
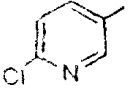
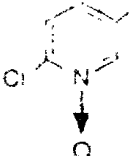
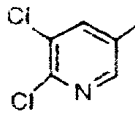
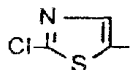
R₁ R₂R₃

物理参数

1.324		H	CH ₃	
1.325		H	CH ₃	
1.326		H	CH ₃	
1.327		H	CH ₃	
1.328		H	CH ₃	
1.329		H	CH ₃	
1.330		H	CH ₃	
1.331		H	CH ₃	

化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
------	---	----------------	----------------	----------------	------

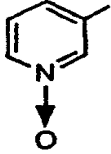
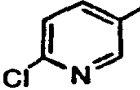
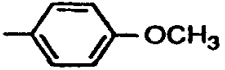
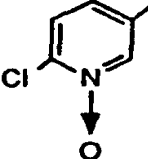
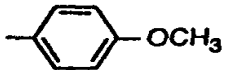
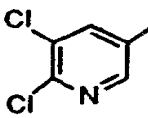
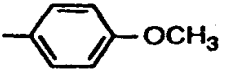
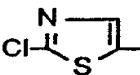
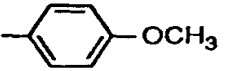
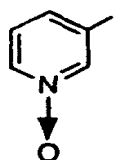
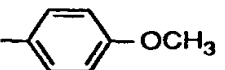
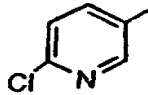
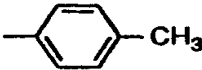
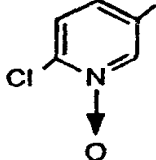
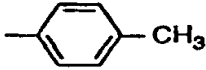
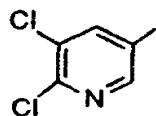
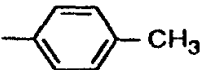


化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
1.341		H	CH ₃		
1.342		H	CH ₃		
1.343		H	CH ₃		
1.344		H	CH ₃		
1.345		H	CH ₃		无定型物质
1.346		H	CH ₃		
1.347		H	CH ₃		
1.348		H	CH ₃		

化合物号 A

R₁ R₂R₃

物理参数

1.349		H CH ₃		
1.350		H CH ₃		m.p. 204°C
1.351		H CH ₃		
1.352		H CH ₃		
1.353		H CH ₃		
1.354		H CH ₃		
1.355		H CH ₃		无定型物质
1.356		H CH ₃		
1.357		H CH ₃		

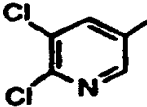
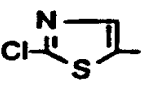
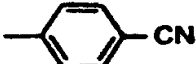
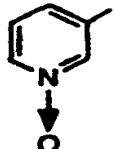
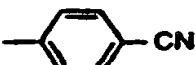
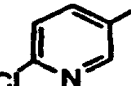
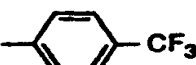
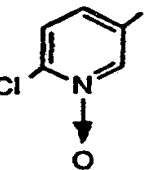
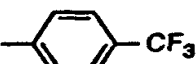
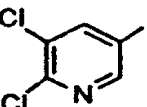
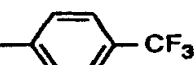
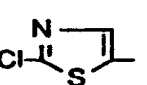
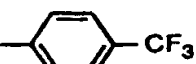
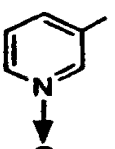
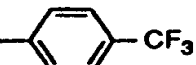
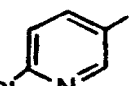
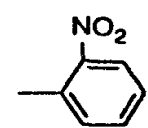
化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
------	---	----------------	----------------	----------------	------

1.358		H	CH ₃		
1.359		H	CH ₃		
1.360		H	CH ₃		m.p. 219°C
1.361		H	CH ₃		
1.362		H	CH ₃		
1.363		H	CH ₃		
1.364		H	CH ₃		
1.365		H	CH ₃		无定型物质
1.366		H	CH ₃		

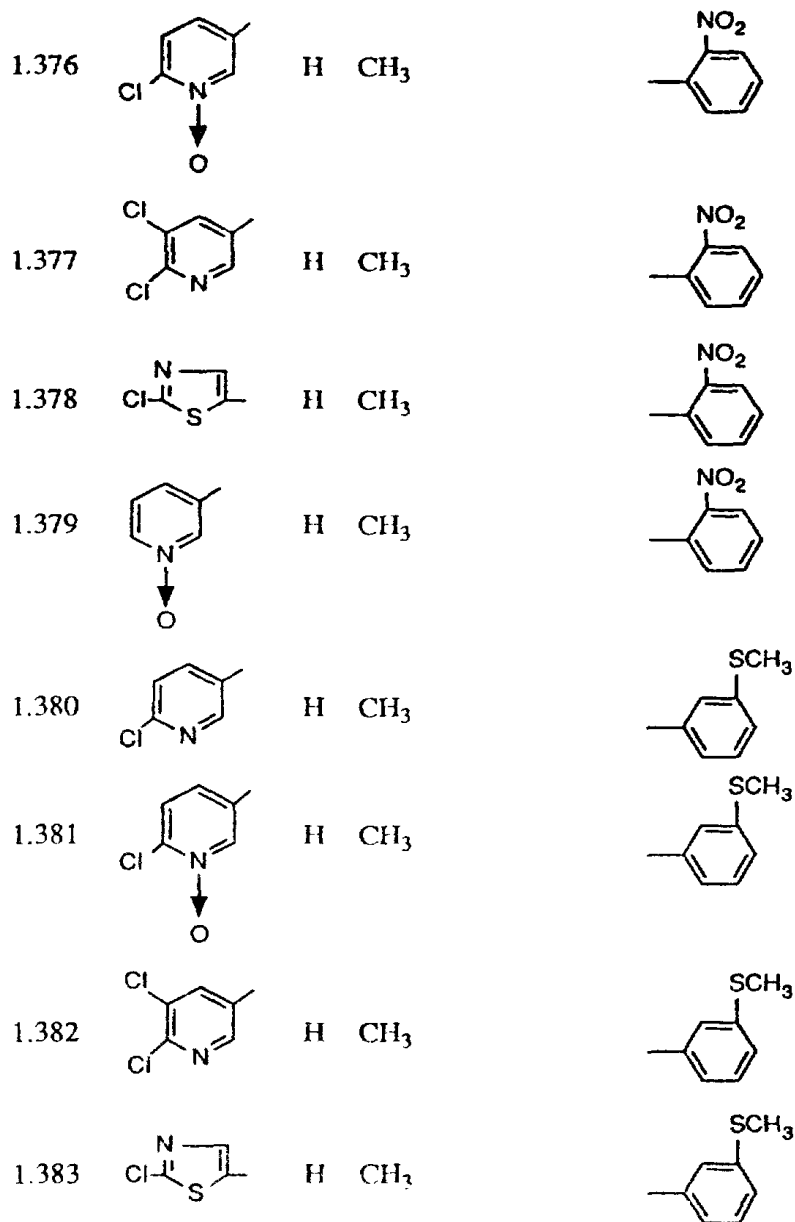
化合物号 A

R₁ R₂R₃

物理参数

1.367		H CH ₃		
1.368		H CH ₃		
1.369		H CH ₃		
1.370		H CH ₃		无定型物质
1.371		H CH ₃		
1.372		H CH ₃		
1.373		H CH ₃		
1.374		H CH ₃		
1.375		H CH ₃		

化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
------	---	----------------	----------------	----------------	------

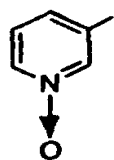
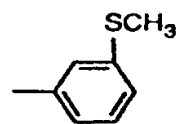


化合物号 A

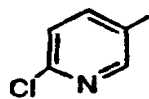
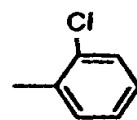
R₁ R₂R₃

物理参数

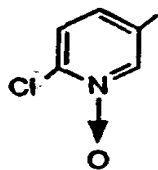
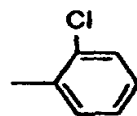
1.384

H CH₃

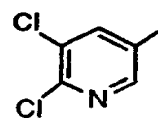
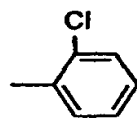
1.385

H CH₃

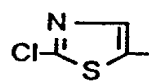
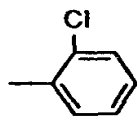
1.386

H CH₃

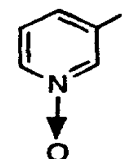
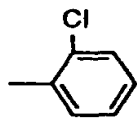
1.387

H CH₃

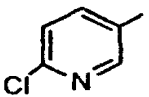
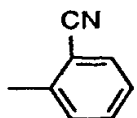
1.388

H CH₃

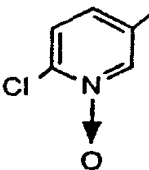
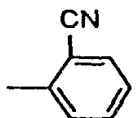
1.389

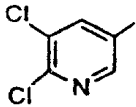
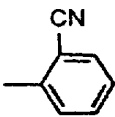
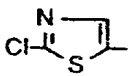
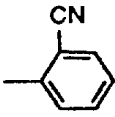
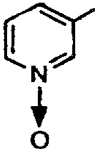
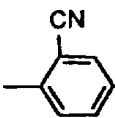
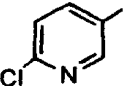
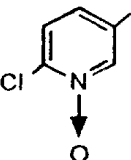
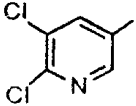
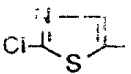
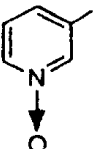
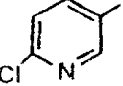
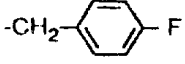
H CH₃

1.390

H CH₃

1.391

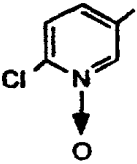
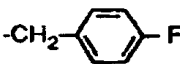
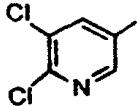
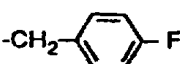
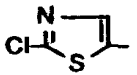
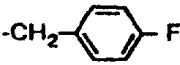
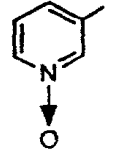
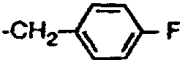
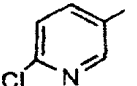
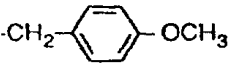
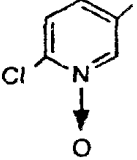
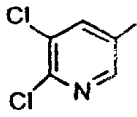
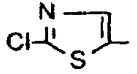
H CH₃

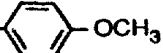
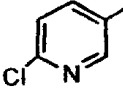
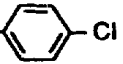
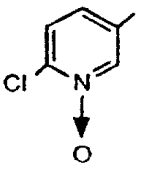
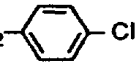
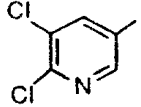
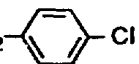
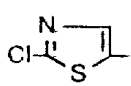
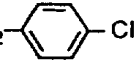
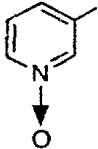
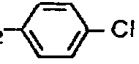
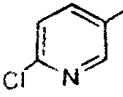
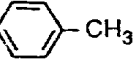
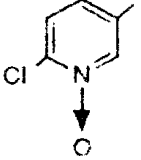
化合物号 A	R ₁ R ₂	R ₃	物理参数
1.392	 H CH ₃		
1.393	 H CH ₃		
1.394	 H CH ₃		
1.395	 H CH ₃	 无定型物质	
1.396	 H CH ₃		
1.397	 II CH ₃		
1.398	 II CH ₃		
1.399	 II CH ₃		
1.400	 II CH ₃	 m.p. 162-164°C	

化合物号 A

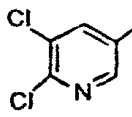
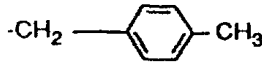
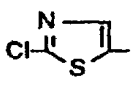
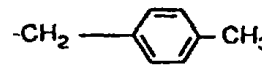
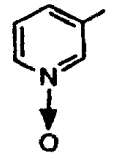
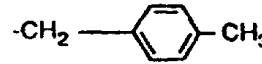
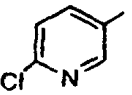
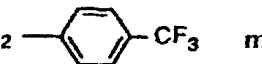
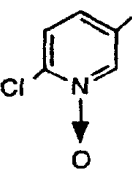
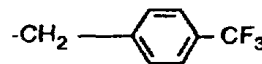
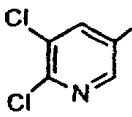
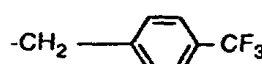
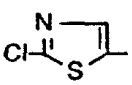
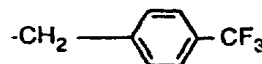
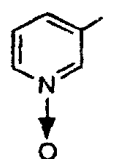
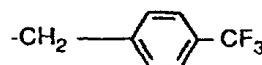
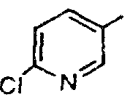
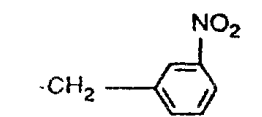
R₁ R₂R₃

物理参数

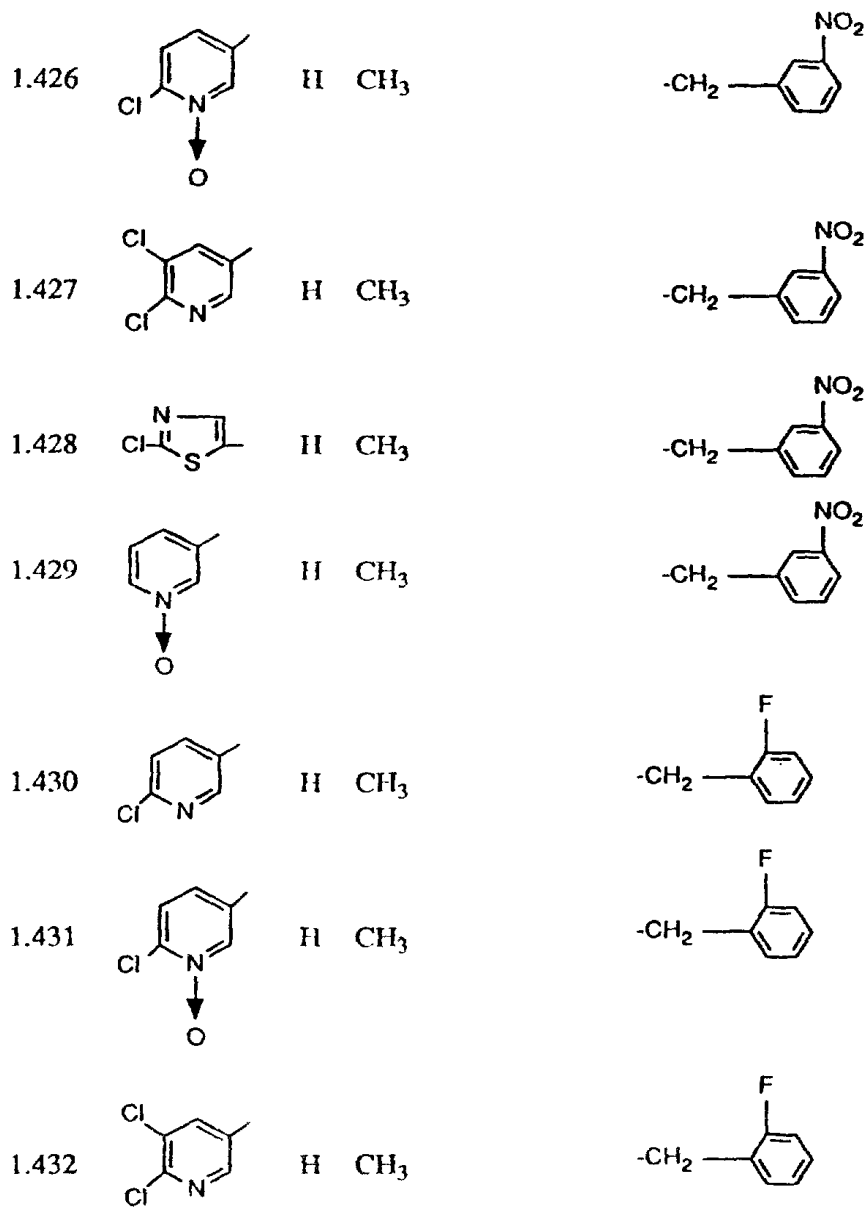
1.401		H	CH ₃		
1.402		H	CH ₃		
1.403		H	CH ₃		
1.404		H	CH ₃		
1.405		H	CH ₃		m.p. 125-127°C
1.406		H	CH ₃		
1.407		H	CH ₃		
1.408		H	CH ₃		

化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
1.409		H	CH ₃	-CH ₂ - 	
1.410		H	CH ₃	-CH ₂ - 	m.p. 147-149°C
1.411		H	CH ₃	-CH ₂ - 	
1.412		H	CH ₃	-CH ₂ - 	
1.413		H	CH ₃	-CH ₂ - 	
1.414		H	CH ₃	-CH ₂ - 	
1.415		H	CH ₃	-CH ₂ - 	m.p. 155-157°C
1.416		H	CH ₃	-CH ₂ - 	

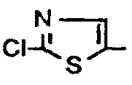
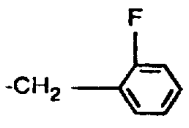
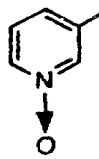
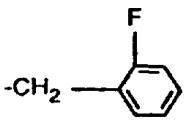
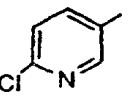
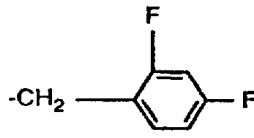
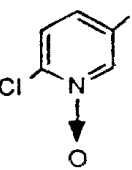
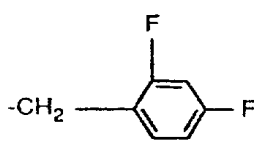
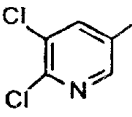
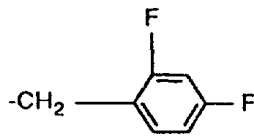
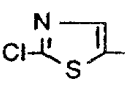
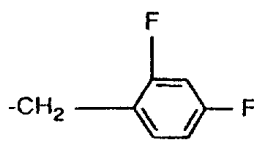
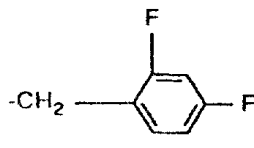
化合物号 A	R ₁ R ₂	R ₃	物理参数
--------	-------------------------------	----------------	------

1.417		H CH ₃	-CH ₂ - 
1.418		H CH ₃	-CH ₂ - 
1.419		H CH ₃	-CH ₂ - 
1.420		H CH ₃	-CH ₂ -  m.p. 167-169°C
1.421		H CH ₃	-CH ₂ - 
1.422		H CH ₃	-CH ₂ - 
1.423		H CH ₃	-CH ₂ - 
1.424		H CH ₃	-CH ₂ - 
1.425		H CH ₃	-CH ₂ - 

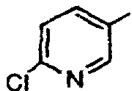
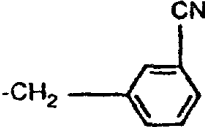
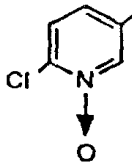
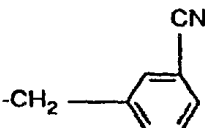
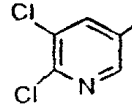
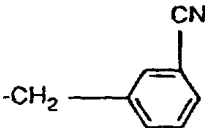
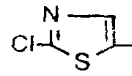
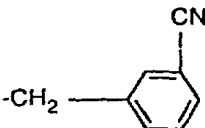
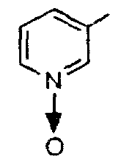
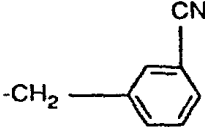
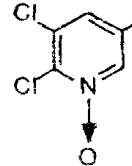
化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
------	---	----------------	----------------	----------------	------



化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
------	---	----------------	----------------	----------------	------

1.433		H	CH ₃		
1.434		H	CH ₃		
1.435		H	CH ₃		
1.436		H	CH ₃		
1.437		H	CH ₃		
1.438		H	CH ₃		
1.439		H	CH ₃		

化合物号	A	R ₁	R ₂	R ₃	物理参数
------	---	----------------	----------------	----------------	------

1.440		H	CH ₃		
1.441		II	CH ₃		
1.442		II	CH ₃		
1.443		II	CH ₃		
1.444		H	CH ₃		
1.445		II	CH ₃	-C ₃ H ₇ (n)	m.p. 157-158°C

实施例3

配方（所有百分数均为重量百分数）

例 F 1：可乳化浓缩物	a)	b)	c)
实施例 2 化合物	25%	40%	50%
十二烷基苯磺酸钙	5%	8%	6%
蓖麻油聚乙二醇醚 (36 mol 环氧乙烷)	5%	—	—
三丁基苯酚聚乙二醇醚 (30 mol 环氧乙烷)	—	12%	4%
环己酮	—	15%	20%
二甲苯混合物	65%	25%	20%

通过用水稀释该浓缩物可生产出任何所需浓度的乳液。

例 F 2：溶液	a)	b)	c)	d)
实施例 2 化合物	80%	10%	5%	95%
乙二醇单甲醚	20%	—	—	—
聚乙二醇 (mol wt 400)	—	70%	—	—
N-甲基-2-吡咯烷酮	—	20%	—	—
环氧化椰子油	—	—	1%	5%
石油馏分 (沸点范围 160—190°C)	—	—	94%	—

以上溶液适于按微滴形式应用。

例 F 3：颗粒剂	a)	b)	c)	d)
实施例 2 化合物	5%	10%	8%	21%
高岭土	94%	—	79%	54%
高度分散的硅酸	1%	—	13%	7%
美国活性白土	—	90%	—	18%

将活性成分溶于二氯甲烷，溶液喷洒到载体上，然后真空蒸发掉溶剂。

例 F 4：粉剂	a)	b)
实施例 2 化合物	2 %	5 %
高度分散的硅酸	1 %	5 %
滑石	97 %	—
高岭土	—	90 %

即用粉剂是通过将载体与活性成分充分混合而制得。

例 F 5：可湿性粉剂	a)	b)	c)
实施例 2 化合物	25%	50%	75%
木素磺酸钠	5%	5%	—
月桂酰硫酸钠	3%	—	5%
二异丁基萘磺酸钠	—	6%	10%
辛基酚聚乙二醇醚 (7—8 mol 环氧乙烷)	—	2%	—
高度分散的硅胶	5%	10%	10%
高岭土	62%	27%	—

将活性成分或活性成分混合物与辅助剂混合，并将混合物在合适的粉碎机中彻底粉碎，所得到的可湿性粉剂可用水稀释成任何所需浓度的悬浮液。

例 F 6：可乳化浓缩物

实施例 2 化合物	1 0 %
辛基酚聚乙二醇醚 (4-5 mol 环氧乙烷)	3 %
十二烷基苯磺酸钙	3 %
蓖麻油聚乙二醇醚 (36 mol 环氧乙烷)	4 %
环己酮	3 0 %
二甲苯混合物	5 0 %

用水稀释该浓缩物可获得任何所需浓度的乳液。

<u>例 F 7：粉 剂</u>	a)	b)
实施例 2 化合物	5 %	8 %
滑石	9 5 %	—
高岭土	—	9 2 %

即用粉剂是通过将活性成分与载体混合并在合适的研磨机中研磨混合物后获得的。

例 F 8：挤压颗粒剂

实施例 2 化合物	1 0 %
木质素磺酸钠	2 %
羧甲基纤维素	1 %
高岭土	8 7 %

将活性成分或活性成分混合物与辅助剂混合粉碎，并用水润湿混合物。将混合物挤压、造粒，然后风干。

例 F 9：包衣颗粒剂

实施例 2 化合物	3 %
聚乙二醇 (mol wt 200)	3 %
高岭土	94 %

将磨碎的活性成分或活性成分组合物在混合器中均匀加到被聚乙二醇润湿的高岭土上。按此方式可获得无尘包衣颗粒剂。

例 F 10：悬浮浓缩物

实施例 2 的化合物	40 %
乙二醇	10 %
壬基酚聚乙二醇醚 (15 mol 环氧乙烷)	6 %
木素磺酸钠	10 %
羧甲基纤维素	1 %
75%水溶性乳液形式的硅油	1 %
水	32 %

将磨碎的活性成分或活性成分混合物与辅助剂完全混合，产生悬浮浓缩物。用水稀释该浓缩物可获得所需任何浓度的悬浮液。

实施例 4：抗稻褐飞虱作用

用含有 400 ppm 试验化合物的水溶性乳液喷洒水稻植株。喷洒层干燥后，向水稻植株上引入 2 龄和 3 龄的蝉幼虫。21 天后进行评

估。通过比较处理过的植株上存活的蝉数与未处理过的植株上存活的蝉数而测定出种群减少的百分数（活性%）。

在该试验中, 实施例2化合物显示出良好的抗稻褐飞虱活性。尤其是, 化合物 1. 0 0 7、1. 0 0 8、1. 0 0 9、1. 0 1 1、1. 0 1 2、1. 0 1 3、1. 0 1 4、1. 0 5 6、1. 0 5 7、1. 0 5 8、1. 1 0 4、1. 1 2 8、1. 1 3 0、1. 1 5 6、1. 2 0 5、1. 2 1 5、1. 3 0 0、1. 3 2 0、1. 3 3 5 和 1. 4 1 0 的防效大于 8 0—9 0%。

实施例5：抗黑尾叶蝉作用

用含有 4 0 0 ppm 试验化合物的水乳剂喷洒水稻植株。喷雾层干燥后, 向水稻植株中引入 2 龄和 3 龄的蝉幼虫。2 1 天后进行评估。通过比较被处理和未被处理植株上存活的蝉数而测定出种群减少的百分数（活性%）。

在试验中, 实施例2化合物显示出良好的抗黑尾叶蝉活性。尤其是化合物 1. 0 0 7、1. 0 0 8、1. 0 0 9、1. 0 1 1、1. 0 1 2、1. 0 1 3、1. 0 1 4、1. 0 5 6、1. 0 5 7、1. 0 5 8、1. 0 6 0、1. 1 0 4、1. 1 2 8、1. 1 5 6、1. 2 0 5、1. 2 1 5、1. 3 0 0、1. 3 2 0、1. 3 3 5 和 1. 4 1 0 的防效均在 8 0 % 以上。

实施例6：抗桃蚜作用

用桃蚜侵袭 豆苗后, 对其喷洒含有 4 0 0 ppm 试验化合物的混合物, 并于 2 0 ℃ 培养。3—6 天后进行评估。通过比较被处理植株和未处理植株上死亡的蚜虫数而测定出种群减少百分数（活性%）。

在该试验中, 实施例2化合物显示出良好的抗桃蚜作用。尤其是

化合物 1. 0 0 1、1. 0 0 2、1. 0 0 6、1. 0 0 7、
1. 0 0 8、1. 0 0 9、1. 0 1 1、1. 0 1 2、1. 1 0 4、
和 1. 1 5 6 的防效均在 8 0 % 以上。

实施例 7：抗豆蚜作用

用豆蚜侵袭豌豆苗后，对其喷洒含有 4 0 0 ppm 试验化合物的混合物，并于 2 0 ℃ 培养。3 - 6 天后进行评估。通过比较处理过的植株与未处理过的植株上的蚜虫死亡数而测定出种群减少的百分数（活性 %）。

在这一试验中，实施例 2 化合物显示出良好的抗豆蚜作用。尤其是，其中化合物 1. 0 0 1、1. 0 0 2、1. 0 0 6、1. 0 0 7、
1. 0 0 8、1. 0 0 9、1. 0 1 1、1. 0 1 2、1. 1 0 4、
1. 1 5 5、1. 1 5 6、1. 2 0 5 和 1. 3 0 0 的防效均在
8 0 % 以上。

实施例 8：抗稻褐飞虱内吸作用

将含有水稻植株的盆置于含有 4 0 0 ppm 试验化合物的水溶性乳液中。然后向水稻植株上引入 2 龄和 3 龄的幼虫。6 天后进行评估。通过比较处理过的植株和未处理过的植株上存活的蝉数而测定出种群减少百分数（活性 %）。

该试验中，实施例 2 化合物显示出良好的抗稻褐飞虱活性。尤其是，其中化合物 1. 0 0 1、1. 0 0 2、1. 0 0 3、1. 0 0 4、
1. 0 0 6、1. 0 0 7、1. 0 0 8、1. 0 0 9、1. 0 1 1、
1. 0 1 2、1. 0 1 3、1. 0 1 4、1. 0 5 7、1. 0 5 8、
1. 0 6 0、1. 1 0 4、1. 1 2 8、1. 1 3 0、1. 1 4 2、
1. 1 5 6、1. 2 0 5、1. 2 1 5、1. 3 0 0、1. 3 2 0、

1. 3 3 5、1. 4 1 0 和 1. 4 4 5 的防效均在 8 0 % 以上。

实施例 9：抗黑尾叶蝉内吸作用

将含有水稻植株的盆置于含有 4 0 0 ppm 试验化合物的水溶性乳液中。然后用 2 龄和 3 龄的幼虫侵袭水稻植株。6 天后进行评估。通过比较处理过和未处理过植株上的蝉数而测定出种群减少百分数（活性 %）。

在该试验中，实施例 2 化合物显示出良好的抗黑尾叶蝉活性。尤其是，其中化合物 1. 0 0 1、1. 0 0 2、1. 0 0 3、1. 0 0 4、1. 0 0 5、1. 0 0 6、1. 0 0 8、1. 0 0 9、1. 0 1 1、1. 0 1 2、1. 0 1 3、1. 0 1 4、1. 0 5 7、1. 0 5 8、1. 0 6 0、1. 1 0 4、1. 1 5 6 和 1. 3 3 5 的防效均在 8 0 % 以上。

实施例 1 0：抗桃蚜内吸作用

用桃蚜侵袭豌豆苗后，将其根浸泡于含有 4 0 0 ppm 试验化合物的喷雾用制剂的混合物中。在 2 0 ℃ 下培养 3 - 6 天后进行评估。通过比较处理过的植株和未处理过的植株上死亡的蚜虫数而测定出种群减少的百分数（活性 %）。

在该试验中，实施例 2 化合物显示出良好的抗桃蚜活性。尤其是，其中化合物 1. 0 0 1、1. 0 0 2、1. 0 0 7、1. 0 0 8、1. 0 0 9、1. 0 1 1、1. 0 1 2、1. 0 2 5、1. 1 0 4 和 1. 1 5 6 的防效均在 8 0 % 以上。

实施例 1 1：抗棉粉虱作用

将矮小蚕豆植株置于薄纱笼中，向笼内引入棉粉虱（whitefly）成虫。产卵后除去成虫。1 0 天后向植株和位于植株上的蛹喷洒化合物的水溶性乳剂（浓度 4 0 0 ppm）。施用试验化合物 1 4 天后，通过

与未处理过的对照比较孵化率(%)而进行评估。

在这一试验中,实施例2化合物显示出良好的抗棉粉虱活性。尤其是,其中化合物1.001、1.002、1.006、1.007、1.008、1.009、1.011、1.012、1.013、1.014、1.016、1.104、1.156和1.335的防效均大于80%。

实施例12:抗猫栉头蚤作用

将20—25个猫蚤卵(猫栉头蚤)放到多个水平放置的50ml细胞培养瓶中,这些瓶中预先已加入含100ppm试验化合物的15g蚤幼虫营养培养基。然后将培养瓶封口,置于温度为26—27℃,湿度为60—70%的培养箱中。培养21天后,对成虫、未孵化的蛹和幼虫进行计数。

在该试验中,实施例2化合物显示出良好的活性。尤其是化合物1.009和1.025的防效均大于80%。

实施例13:抗德国小蠊作用

将足以产生1g/m²浓度的0.1%试验化合物的丙酮溶液加到直径10cm的培养皿中。蒸发掉溶剂后,向该平皿中放入10个德国小蠊蛹(最后蛹期),并用试验化合物处理2小时。然后用CO₂使蛹麻醉,放置到新培养皿中,置于25℃、湿度约70%的暗处。48小时后通过测定死亡率评估杀虫作用。

在上述试验中,实施例2化合物显示出良好活性。尤其是,其中化合物1.104的防效大于60%。

实施例14:抗微小牛蜱作用

将吸满血的成年雌性蜱固定于PVC平板上,并盖上棉毛签。进行处理

时，将含有 1 2 5 ppm 试验化合物的 1 0 ml 试验水溶液倒在试验昆虫上。除去棉签，将蜚培养 4 周，直到开始产卵。可通过雌性的死亡或不育或对卵的杀伤作用证明抗微小牛蜚作用。

实施例 2 化合物显示出良好的抗微小牛蜚活性。尤其是，其中化合物 1. 0 0 8、1. 0 0 9 和 1. 0 2 5 的防效均大于 6 0 %。