〔19〕中华人民共和国专利局

〔11〕公开号 CN 1045772A

〔12〕发明专利申请公开说明书

〔21〕 申请号 90101539.3

〔51〕 Int.Cl⁵

C07C 69/635

〔43〕公开日 1990年10月3日

〔22〕申请日 90.3.15

〔30〕优先权

〔32〕89.3.15 〔33〕DE 〔31〕P3908901.0

〔71〕申请人 先灵公司

地址 联邦德国柏林

〔72〕发明人 冈特·赫姆堡格 阿尼姆·柯恩

彼得·韦格纳

哈拉尔德·V·凯泽林克

〔74〕专利代理机构 中国专利代理有限公司

代理人 曹恒兴

A01N 37/02 A01N 37/10

说明书页数: 16 附图页数:

〔54〕发明名称 2-卤代环丙基乙烷衍生物及其制备方法和在杀虫剂上的应用

〔57〕摘要

本发明提供了新的通式Ⅰ的2-卤代环丙基乙烷衍生物和新的通式Ⅱ的中间体以及式Ⅰ化合物的制备方法，

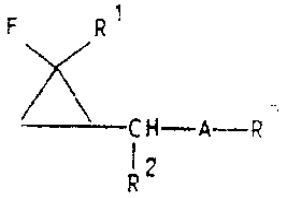


式中 R^1, R^2, R^3, A 和 X 的含意在说明书中给出。

本发明化合物可用作杀虫剂，尤其可用于杀昆虫和螨。

权　利　要　求　书

1. 杀虫杀螨组合物，包括通式I 的2-卤代环丙基乙烷衍生物与农业上可接受的稀释剂或载体混合，



(I)，

式中R^1是氢和氯，

R^2是氢，C_{1-6}烷基，芳基或芳基-C_{1-2}-烷基，

A 是$-CH_2-B-\overset{\overset{D}{\|}}{C}-$ 或 $-\overset{\overset{D}{\|}}{C}-E-$

（其中 $B-\overset{\overset{D}{\|}}{C}-$或E-与$R^3$键合，B和D 是氧或硫），

E 是氧，硫或NR^4，

R^3和R^4各为氢，碱金属或相当于2 价金属等同物，C_{1-20}烷基，C_{2-20}链烯基，C_{2-20}炔基，卤代C_{1-10}烷基，C_{3-6}环烷基，C_{1-3}-烷基-C_{3-6}-环烷基，C_{3-6}-环烷基-C_{1-6}-烷基，卤代C_{3-6}-环烷基-C_{1-6}-烷基，二环烷基，含氯氟环丙基甲基碳酰氧基-C_{1-10}-烷基，含氯氟环丙基碳酰氧基-C_{1-3}-烷氧基-C_{1-3}-烷基，芳基-C_{1-6}-烷基，芳基-C_{2-6}-链烯基，卤代芳基-C_{1-6}-烷基，C_{1-4}-烷芳基-C_{1-4}-烷基，卤代芳基-C_{2-6}-链烯基，卤代-C_{1-4}-烷芳基-C_{1-6}-烷基，C_{1-3}-烷氧基芳基-C_{1-6}-烷基，芳氧基苄基，α-C_{1-3}-烷基苯氧基苄基，卤代苯基(环丙基)-C_{1-3}-烷基，卤代苯

氧基-C_{1-6}-烷基，萘基-C_{1-6}-烷基，芳基，可任意被1 个或多个下列基团取代：C_{1-20}-烷基，卤代-C_{1-6}- 烷基，C_{1-16}-烷氧基，卤代-C_{1-6}-烷基氧基，苯基-C_{1-6}-烷基，苯基-C_{1-4}-烷氧基，C_{3-10}-环烷氧基，卤代-C_{3-10}-环烷氧基，C_{3-6}环烷基烷氧基，卤代-C_{3-6}-环烷基烷氧基，C_{2-6}-链烯基氧基，卤代-C_{2-6}-链烯基氧基，C_{2-6}-炔氧基，卤代-C_{2-6}-炔氧基，烷基磺酰氧基，烷基苯基磺酰氧基，卤代烷基磺酰氧基，苯基，卤原子，氨基，氰基，羟基，硝基，芳氧基，杂芳氧基，卤代芳氧基，芳基氨基，卤代芳基氨基，C_{1-6}- 烷氧基羰基，C_{1-6} 烷氧基羰基甲基，卤代-C_{1-6}- 烷氧基羰基，C_{1-2}-烷基二氧基，C_{1-6}烷硫 基，卤代-C_{3-6}- 环烷基烷基氨基，卤代-C_{3-6}-环烷基烷基磺酰氧基， C_{1-6}-烷基氨基或二-C_{1-6}-烷基氨基，或杂芳基，可任意被卤原子，C_{1-3}-烷基或卤代-C_{1-3}-烷基取代。

2. 防治虫和螨的方法，包括将有效量的权利要求1 组合物施用于虫或螨或其所在场所。

说　　明　　书

2-卤代环丙基乙烷衍生物及其制备方法和在杀虫剂上的应用

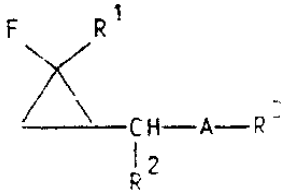
本发明涉及新的2-卤代环丙基乙烷衍生物及其制备方法和在杀虫剂（特别是昆虫和螨）上的应用。

公众已经知道，环丙烷化合物具有杀螨杀虫的性质(EP 116889)。

然而已知化合物的缺点是其杀虫杀螨的活性不高。

为此，本发明的目的在于提供杀虫杀螨活性高于已知化合物的新的化合物。

现已得到通式I 的2-卤代环丙基乙烷衍生物与已知化合物相比，具有更高的杀虫杀螨活性



(I),

式中R^1是氢和氯，

R^2是氢，C_{1-6}-烷基，芳基或芳基-C_{1-3}-烷基，

A 是$-CH_2-B-\overset{\overset{D}{\|}}{C}-$ 或 $-\overset{\overset{D}{\|}}{C}-E-$

$\overset{\overset{D}{\|}}{B-C}-$或E-与$R^3$键合，B和D 是氧或硫)，

E 是氧，硫或NR^4，

R^3和R^4各为氢，碱金属或相当于2 价金属等同物，C_{1-20}烷基，C_{2-20}链烯基，C_{2-20}炔基，卤代C_{1-10}烷基，C_{3-6}环烷基，C_{1-3}-烷基-C_{3-6}-环烷基，C_{3-6}-环烷基-C_{1-6}-烷基，卤代C_{3-6}- 环烷基-C_{1-6}-烷基，二环烷基，含氯氟环丙基甲基碳酰氧基-C_{1-10}-烷基，含氯氟环丙基碳酰氧基-C_{1-3}-烷氧基-C_{1-3} - 烷基，芳基-C_{1-6}-烷基，芳基-C_{2-6}-链烯基，卤代芳基-C_{1-6}-烷基，C_{1-4}-烷芳基-C_{1-4}-烷基，卤代芳基-C_{2-6}-链烯基，卤代-C_{1-4}-烷芳基-C_{1-6}-烷基，C_{1-3}-烷氧基芳基-C_{1-6}-烷基，芳氧基苄基，α-C_{1-3}-烷基苯氧基苄基，卤代苯基(环丙基)-C_{1-3}-烷基，卤代苯氧基-C_{1-6}-烷基，萘基-C_{1-6}-烷基，芳基，可任意被1 个或多个下列基团取代：C_{1-20}-烷基，卤代-C_{1-6}- 烷基，C_{1-16}-烷氧基，卤代-C_{1-6}-烷氧基，苯基-C_{1-6}-烷基，苯基-C_{1-6}-烷氧基，C_{3-10}-环烷氧基，卤代-C_{3-10}-环烷氧基，C_{3-6} - 环烷基烷氧基，卤代-C_{3-6}-环烷基烷氧基，C_{2-6}-链烯基氧基，卤代-C_{2-6}-链烯基氧基，C_{2-6}-炔氧基，卤代-C_{2-6}-炔氧基，烷基磺酰氧基，烷基苯基磺酰氧基，卤代烷基磺酰氧基，苯基，卤原子，氨基，氰基，羟基，硝基，芳氧基，杂芳氧基，卤代芳氧基，芳基氨基，卤代芳基氨基，C_{1-6}- 烷氧基羰基，C_{1-6}- 烷氧基羰基甲基，卤代-C_{1-6}- 烷氧基羰基，C_{1-2}-烷基二氧基，C_{1-6}-烷硫基，卤代-C_{3-6}- 环烷基烷基氨基，卤代-C_{3-6}-环烷基烷基碳酰氧基，C_{1-6}-烷基氨基或二-C_{1-6}-烷基氨基，或杂芳基，可任意被卤原子，C_{1-3}-烷基或卤代-C_{1-3}-烷基取代。

本文中所述术语的含义：

“烷基”包括直链和支链的碳链。

“链烯基”包括能含1 个或多个双键的直链和支链的碳链。

“炔基”包括能含1 个或多个三键的直链和支链的碳链。

“芳基”系指1-3 环芳基，例如苯基，萘基或菲基。

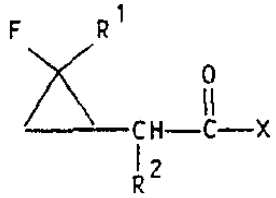
“杂芳基”系指5-或6-元环，含有1 个或多个氮、氧或硫原子，能够是饱和的、部分饱和的或不饱和的，并能任意带稠苯并环，例如吡

啶、噻唑或苯并吡喃。

R^3和R^4可任意和与之连接的氮原子形成饱和环或不饱和环，例如吗啉代，哌啶子基，吡咯并，咪唑子基或均三唑并。

式I 化合物可作为任意的旋光异构体的混合物存在。本发明不仅涉及异构混合物，而且还包括本发明各化合物的异构体。

本发明还涉及作为制备式I 化合物的中间体的式II化合物



(II),

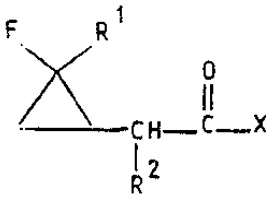
式中R^1和R^2 的含意与式I 相同，

X 是OH, Cl 或Br。

新的中间体特别适合于制备A 表示 $-\overset{O}{\overset{\|}{C}}-E-$的式I 化合物。

A 表示$-\overset{O}{\overset{\|}{C}}-E-$ 的本发明式I 的2-卤代环丙基乙烷衍生物可按下述方法制备:

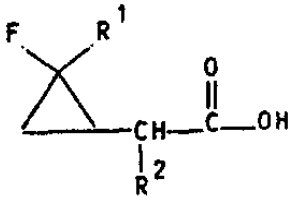
A) 通式II的酰基卤在任意的溶剂中和酸性接受体存在下与通式III的醇或胺反应，



(II), $H-E-R^3$ (III),

式中E, R^1, R^2 和R^3的含意与式I 相同，X 是氯或溴，或

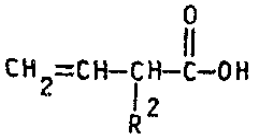
B) 通式IV的游离酸在任意的催化剂存在下和溶剂中与式III的醇或胺反应，



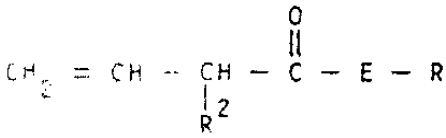
(IV),

式中R^1和R^2的含意与式I 相同，或

C) 通式V 的酸在任意的催化剂或脱水剂存在下和溶剂中与式III的醇或胺反应，生成式VI的中间体，并在惰性溶剂存在下将其与含氯氟卡宾反应，



(V),

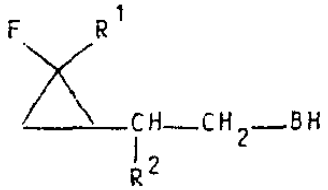


(VI),

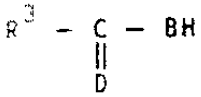
式中E，R^2和R^3的含意与式I 相同，

或当A 为$-CH_2-B-\overset{\overset{O}{\|}}{C}-$ 时化合物可按下述方法制备：

D) 通式VII的醇在任意的溶剂中和催化剂存在下与通式VIII的酸反应，



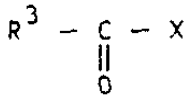
(VII),



(VIII),

式中B，D，R^1，R^2 和R^3的含意与式I 相同，或

E) 通式VII的醇在任意的溶剂中和酸性接受体存在下与通式IX的酰基卤反应，

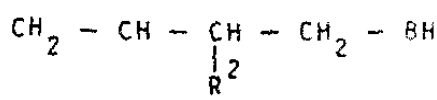


(IX),

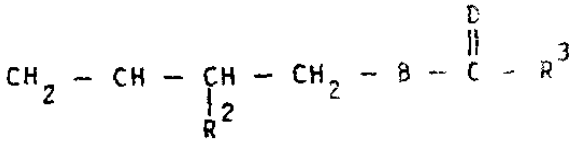
式中X 是氯或溴，

R^3的含意与式I 相同，或

F) 通式X 的醇在任意的溶剂和催化剂中与式Ⅷ的酸反应，生成式XI的中间体，并在惰性溶剂存在下，将其与含氯氟卡宾反应



(X)，



(XI)，

式中B，D，R^2和R^3的含意与式I 相同，或

G) 通式X的醇在任意的溶剂和酸性接受体中与通式IX的酰基卤反应，生成式XI的中间体，并在惰性溶剂存在下将其与含氯氟卡宾反应。

常规的碱性材料均适宜用作反应方法A)，E) 和G) 的酸性接受体，其中尤其适用的是脂族、芳族和杂环的胺，例如三乙胺，二甲胺，哌啶，二甲基苯胺，二甲基苄胺，吡啶和二甲基氨基吡啶，或无机碱，例如碱金属和碱土金属的氧化物，氢氧化物，碳酸盐，碳酸氢盐和醇化物，如氢氧化钾，氢氧化钠，碳酸钠和碳酸钾。

适合的溶剂系上述酸性接受体或惰性溶剂或其混合物。

以上所述的实例包括：可任意被氯化的脂族烃，脂环烃和芳烃，例如已烷，环已烷，石油醚，苯，甲苯，二甲苯，二氯甲烷，三氯甲烷，四氯化碳，1，2-二氯乙烷，三氯乙烯和氯苯；醚类，例如二乙醚，甲基乙基醚，二异丙醚，二丁醚，二噁烷和四氢呋喃；酮类，例如丙酮，甲基乙基酮，甲基异丙基酮和甲基异丁基酮；腈类，例如乙腈，丙腈和苄腈；酯类，例如乙酸乙酯和乙酸甲酯；酰胺类，例如二甲基甲酰胺和二

甲基乙酰胺；以及砜和亚砜，例如二甲亚砜和四氢噻吩砜。

反应可在很宽的温度范围内进行。一般在-20 ℃至反应混合物沸点的温度范围内进行，尤以20-200℃为佳。

反应可在常压下进行，也可在较高压力或低压下进行。

适合于进行反应方法B)，D) 和F) 的催化剂包括强酸，例如硫酸，卤氢酸，磺酸和酸性离子交换剂。如从反应混合物中除去水或式I 的酯则更为有利，例如可采用共沸蒸馏或将水与硫酸或卤氢酸结合。

反应方法B) 可在类似反应条件、温度和压力下进行，并可采用如反应方法B 、A) 的同样溶剂或其混合物。

为了制备用于反应方法C) 中的式VI中间体化合物，可以使用与反应方法B 中相同的酸催化剂和惰性溶剂。尤其适用于酯化的是通过三苯膦与偶氮二羧酸酯结合而与水结合(Syntheses，1981，1，1)。适合用的还有经典的脱水剂，例如浓硫酸，无水无机酸盐，例如硫酸镁或氯化钙，碳化二亚胺，例如二环已基碳化二亚胺，还有沸石。然而卡宾反应最好是在醚中进行，例如甘醇二甲醚，三甘醇二甲醚和四甘醇二甲醚。

含氯氟卡宾可按已知方法制备(参图Walselman et at.，Synthesis 1985.754) 。最好在高沸点溶剂中由二氯氟乙酸盐制备，例如甘醇二醚三甘醇二甲醚和四甘醇二甲醚。

适合的含氯氟卡宾发生剂例如有卤代氟烃，如二氯氟甲烷和碱金属二氯氟乙酸盐，如二氯氟乙酸钠。

本发明的旋光异构体可按常规方法制备。例如式II化合物与手心试剂(如旋光胺或旋光醇) 反应，分离由物理方法(Tetrahedron，33，2725 1977)(例如重结晶法，蒸馏法或闪层析法) 得到的非对映体。通过能被酸或碱催化的连续水解裂解，得到通式IV的游离酸的旋光异构体，再用反应方法B) 转化为本发明化合物。

此外，由合成得到的通式I 的旋光异构体的混合物，通过在手性固

定相上层析，可以分离成对映体，例如与聚合物结合的环糊精，淀粉或旋光氨基酸(Angew.Chem.,92,14,1980)。

按上述方法制备的本发明化合物可用常规方法，从反应混合物分离出来，例如采用在常压或减压下将所用溶剂进行蒸馏，用水沉淀或提取。

通常采用薄层层析法、分馏蒸馏或重结晶，均可获得高度纯化。

一般说来，本发明化合物几乎是无色无味的粘性油或晶体，几乎不溶于水，有限地溶于脂族烃，如石油醚，已烷，戊烷和环已烷，易溶于氯化的烃，例如三氯甲烷，二氯甲烷和四氯化碳；芳族烃，例如苯，甲苯或二甲苯；醚类，例如二乙醚，四氢呋喃和二噁烷；腈类，例如乙腈；醇类，例如甲醇和乙醇；酰胺类，例如二甲基甲酰胺；以及亚砜，例如二甲亚砜。

式IX的酰基卤，式Ⅷ的酸，式Ⅲ的醇和胺均为已知的，也可按已知方法制备。

本发明化合物的特征在于具有很高的杀虫活性，尤其是杀螨活性很高，因此在本领域中是一项重要的改进。根据它们对吸吮节肢动物的广谱活性。本发明化合物不仅可用于作物害虫，而且也可用于消灭人和家畜上的寄生虫。本发明化合物的活性就对其他物质具有抗药性的寄生虫来说，具有特别重要的意义。由于本发明化合物能被植物吸入并在整个植株内传输，因此也能用于土壤，从而到达不能直接处理的植株的部位。

能够用本发明化合物防治的虫螨(包括动物外寄生虫)有：例如鳞翅目，如小菜蛾(Plutella xylostella)，Spodoptera littoralis，棉铃虫(Heliothis armigera)和大菜粉蝶(Pieris brassica)；双翅目，如家蝇(Musca domestica)，地中海实蝇(Ceratitis capitata)，甘兰根花

蝇(Erioischia brassicae)，丝光绿蝇(Lucilia sericata)和Aedes aegypti；同翅目，包括蚜虫科，如日本修尾蚜(Megoura viciae)和稻褐飞虱(Nilaparvata lugens)；鞘翅目，如辣根猿叶虫(Phaedon cochleariae)，棉铃象(Anthonomus grandis)，Epilachna varivestis 和玉米根螟(Diabrotica spp.，如玉米根螟-Diabrotica undecimpuncta ta)；直翅目，如德国小蠊(Blattella germanica)；蜱，如微小牛蜱(Boophilus microplus)和虱，如Damalinia bovis 和牛颚虱(Lingnathus vituli)，以及叶螨科，如二点叶螨(Tetranychus urticae) 和苹果全爪螨(Panonychus ulmi) 。

本发明化合物可使用的浓度按每100ml 组合物含克活性物质计为0.0005-5%，尤以0.001-0.1%为佳。

本发明化合物既可单独使用，也可相互混合使用，或与其他杀虫剂混合使用。根据需要，还可任意加入其他植物保护剂或杀虫剂，例如杀虫剂，杀螨剂或杀菌剂。

为了提高作用的强度和速度，例如可以加入适当的助剂，如有机溶剂，湿润剂和油类。加入这类添加剂时可以允许减少活性成份的剂量。

适宜于混合配制的还可包括磷脂类，例如磷脂酰胆碱，氢化磷脂酰胆碱，磷脂酰乙醇胺，N- 酰基- 磷脂酰乙醇胺，磷脂酰肌醇，磷脂酰丝氨酸，溶血卵磷脂和磷脂酰甘油。

特征活性组份或其混合物可加入液体和/ 或固体载体和/ 或稀释剂以及任意的粘合剂，湿润剂，乳化剂和/ 或分散剂，适合于配制成粉剂，尘粉剂、颗粒剂，溶液，乳液或悬浮液。

适合的液体载体物质例如有脂族烃和芳香烃，如苯，甲苯，二甲苯，环已酮，异佛尔酮，二甲亚砜，二甲基甲酰胺，其他矿物油馏份和植物油。

适合的固体载体物质有矿物土，例如Tonsil，硅胶，滑石，高岭

土，美国活性土(Attapulgit)，石灰岩，硅酸和植物产品，如面粉。

使用的表面活性物质例如有木素磺酸钙，聚乙烯烷基苯基醚，萘磺酸及其盐，苯酚磺酸及其盐，甲醛缩合物，脂肪族醇的硫酸盐和取代的苯磺酸及其盐。

各种制剂中活性组份的百分率可在很宽的范围内变化。例如，组合物中可约含10-90(重量)%活性组份和约含90-10(重量)%液体或固体载体，以及任意地可含高至20(重量)%的表面活性剂。

制剂可按常规方法使用，例如用水作为载体，喷雾混合物的体积用量约为100-3000升/公顷。制剂也可采用低体积或超低体积技术使用，形成所谓的微粒。

制备制剂的组份例举如下:

A.可湿润粉剂

20(重量)%活性物质

35(重量)%膨润土

8 (重量)%木素磺酸钙

2 (重量)%N-甲基-N-油酰-牛磺酸钠盐

35(重量)%硅酸

B.糊状剂

45(重量)%活性物质

5 (重量)%硅酸铝钠

15(重量)%含8mol环氧乙烷的十六烷基聚乙二醇醚

2 (重量)%锭子油

10(重量)%聚乙二醇

23份水

C.乳化浓缩剂

20(重量)%活性物质

75(重量)%异佛尔酮

5 (重量)%以N-甲基-N- 油酰- 牛磺酸钠盐和木素磺酸钙为主要成份的混合物

以下实施例说明本发明化合物的制备。

实施例1:4-(2- 丙氧基)-苯甲酸-2-(2-氯-2- 氟环丙基) 乙酯

1.将35.9g(0.14mol)三苯膦和15.5ml(0.18mol)3- 丁烯-1- 醇和150ml 四氢呋喃的溶液冷却滴加到25g(0.14mol)4-(2- 丙氧基) 苯甲酸和22.5ml(0.14mol) 偶氮二羧酸二乙醚的四氢呋喃(150ml) 溶液中, 该混合物在室温下搅拌5 小时。溶剂蒸发后, 反应产物经硅胶柱层析并用已烷/ 乙酸乙酯(95:5)洗脱提纯, 样品用薄层层析和已烷/ 乙酸乙酯(8:2) 洗脱进行分析(Rf:0.61) 。

得到29g(理论值的89%)4-(2- 丙氧基)-苯甲酸-3- 丁烯-1- 酯。

2.60g(0.58mol)二氯氟甲烷(氟利昂21) 在5-6 ℃下通过经剧搅拌的21g(0.09mol)4-(2- 丙氧基)-苯甲酸-3- 丁烯-1- 酯。100ml 50% 氢氧化钠水溶液。150ml 二氯乙烷和1g(4.4mol)三乙苄基氯化铵的混合物1-2 小时。该混合物在5 ℃下搅拌3 小时后, 倒入500ml 水中, 用100ml 二氯甲烷提取2 次。将有机相合并, 用水洗涤, 硫酸镁干燥。粗制品在溶剂蒸发后经硅胶柱层析(洗脱剂/ 乙酸乙酯,95:5)提纯, 样品用薄层层析(洗脱剂已烷/ 乙酸乙酯,8 2) 分析(Rf=0.53) 。

得到4.5g(理论值的16%)4-(2- 丙氧基)-苯甲酸-2-(2-氯-2- 氟-环丙基) 乙酯。

n_D^{20}:1.5139。

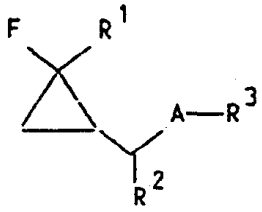
实施例2:2-(2- 氯-2- 氟环丙基)-乙酸-2- 萘甲酯

将3.61g(0.016mol)3- 苯甲酸-2- 萘甲酯的甘醇二甲醚(40ml)溶液加热到162 ℃。在这个温度下, 滴加8.1g(0 048mol)二氯氟乙酸钠的甘醇二甲醚(60ml)溶液1 小时。混合物冷却后, 用油真空泵蒸馏溶剂。残

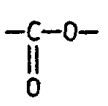
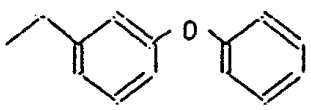
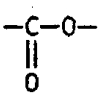
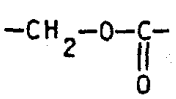
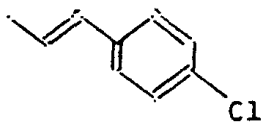
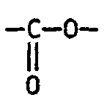
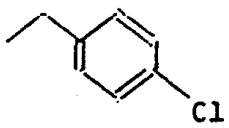
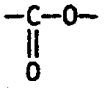
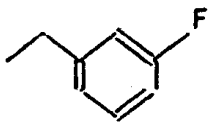
渣溶于乙酸乙酯，提取液用水洗涤2 次，硫酸镁干燥，在旋转蒸发器上浓缩。粗制品用硅胶柱层析(洗脱剂已烷/ 乙酸乙酯,99:1)提纯，样品用薄层层析分析(洗脱剂已烷/ 乙酸乙酯,8:2)(Rf:0.39)。

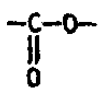
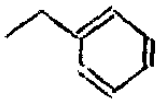
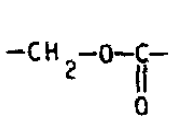
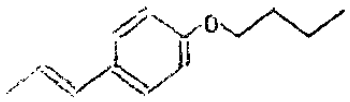
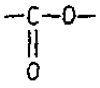
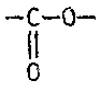
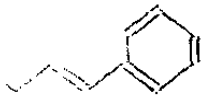
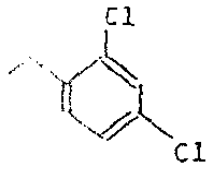
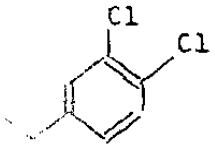
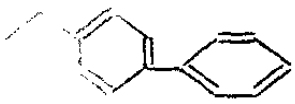
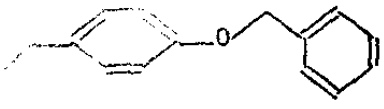
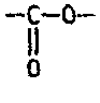
得到1.7g(理论值的36%)2-(2- 氯-2- 氟环丙基)-乙酸-2- 萘甲酯。 n_D^{20}: 1.5669

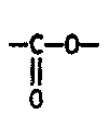
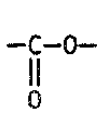
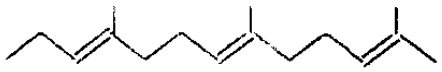
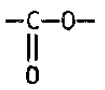
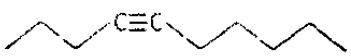
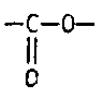
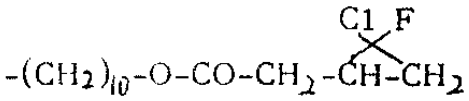
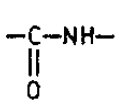
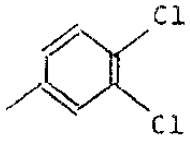
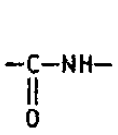
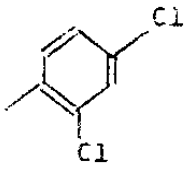
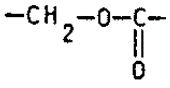
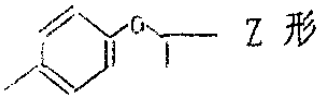
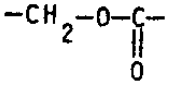
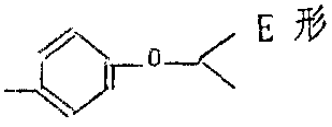
按相似方法制备下列化合物。



R^1 = Cl
R^2 = H

实施例	方法	A	R^3	n_D^{20} 或 Fp. [°C]
3	C			1,5491
4	C		$n\text{-}C_{16}H_{33}$	1,4509
5	F			1,5576
6	C			1,5164
7	C			1,4911

8	C			1,5031
9	F			1,5385
10				$[R_f$ = 0,15 于乙酸乙酯中)
11	A			1,5338
12	A			1,5303
13	A			1,5313
14	A			1,5695
15	A			1,5497
16	A			1,4584

17	A			1,4717	
18	A			1,4809	
19	A			1,4585	
20	A			1,4579	
21	A				101,4
22	A				79,6
23	F			1,5118	
24	F			1,5150	

应用例A: 食物预防处理对蚕豆蚜(Aphis fabae scop.) 的活性

从矮蚕豆(Phaseolus vulgaris nanus Aschers.) 的初生叶片上，切下直径24mm圆片，将其未经处理和经0.1%本发明化合物的水制剂处理过的叶片置于滤纸上，叶片背面向上。待其干后，各用未展翅期的蚕豆蚜(每个叶片约100 个虫) 放在叶片上。试验重复3 次。叶片在25℃和每天16小时光照下放在湿滤纸上2 天。然后统计死亡百分率。并与未处理过对照相比，按Abbott方法计算活性。

实施例2,4,6,7,8 和11-22 的化合物，活性达80% 以上。

应用例B: 叶片预防处理对稻褐飞虱(Niliparvata lugens Stal) 叶片的活性

取两个叶片期的稻苗(Oryzae sativa L.)将未处理过的和用含0.1%活性组份的水制剂浸润处理过的置于6.5 ×6.5cm 聚苯乙烯钵内，每钵约放10株苗。待叶片干后，在每个钵上放置一个聚苯乙烯圆筒，通过其上部的开孔用二氧化碳将约30个第4-5 期的稻褐飞虱引入钵中，再用细网筛将开孔盖上。将钵移入28℃和每天16小时光照的温室内，放置2 天后，统计虫的死亡数和死亡百分率，与未处理过的对照相比，按Abbott方法计算活性。

实施例1-7,11,12,18和23的化合物，活性达到80% 以上。

应用例C: 食物预防处理对二点叶螨(Tetranychus urticae Koch) 的活性

从矮蚕豆(Phaseolus vulgaris nanus Aschers.) 的初生叶片上，切下直径14mm的圆片，其中有些叶片用0.1%本发明化合物的水制剂处理，有的未经处理，然后置于滤纸上，叶片的背面向上。待经处理过的样品干后，在每个叶片上放上6 个雌性二点叶螨成虫，在25℃和每天16小时光照条件下放置3 天。试验重复4 次。数出死活虫数后，全部移走。用同样的方法，数出产下的卵数，再隔7 天后，数出活的幼虫数。

与未处理过的对照相比，按Abbott方法计算活性。

实施例1-9 和11-24 的化合物，活性达80-100% 。

应用例D: 矮蚕豆(Phascolus vulgaris nanus Aschers.)的防治处理对二点叶螨卵的活性

在加热温室中，矮蚕豆苗长至初生叶完全展开时，用雌性二点叶螨成虫处理，一天后植株上已带卵，用0.1%活性组份的水制剂喷至滴湿。在22-24 ℃下,7天后，统计经处理和未经处理的植株上虫卵的死亡数，按Abbott方法计算活性。

实施例 1,3,8和11-22 的化合物，活性达80-100% 。

应用例E: 对玉米根螟(Diabrotica undecimpunctata)的卵和幼虫的活性

将本发明化合物配制成浓度为0.1%的水制剂。在装有土壤的聚苯乙烯培养皿中，放有玉米苗(每皿1 株) 和约50个玉米根螟(diabrotica undecimpunctata)卵，然后将0.2ml 的上述制剂滴入培养皿的土壤中，加盖，在25℃和长光照条件下放置7 天。判断活性的标准是在试验结束时，卵或新孵出的幼虫的死亡数。

实施例8,16,22 和23的化合物，活性达80-100%

应用例F: 对棉铃虫(Heliothis viriscens) 卵的杀卵活性

将本发明化合物配制成浓度为0.1%的水制剂，再将受过精的雌虫产生的一天令卵放在滤纸上，浸在上述制剂中至完全湿润，移入加盖的培养皿中，在长光照条件下放置4 天。与未处理过的卵相比，以抑制卵孵化的百分率表示活性水平。

实施例2,5,6,7,8,11,13,16,19,22和23的化合物，活性达80-100%

应用例G: 对丝光绿蝇(Lucilia sericata)的杀虫活性

将试验化合物配制成不同浓度的丙酮溶液，取其1ml 等份溶液涂在1cm ×2cm 棉球上，放入直径2cm 长5cm 的玻璃管内。干后，经处理过

的材料用1ml 营养液浸渍，放上丝光绿蝇(Lucilia sericata)初令幼虫，用棉球塞将玻璃管塞住，在25℃下放置24小时。

对照的死亡率<5%，而实施例11-14，19和20的化合物，LC50为300ppm或更低。

应用例H：对微小牛蜱(Boophilus microplus) 的活性

将试验化合物配制成不同浓度的丙酮溶液，取其1ml 等份溶液浸渍滤纸(直径9cm)，待滤纸干后，折叠成信封，装入微小牛蜱(Boophilus microplus)，在25℃温度和80% 相对湿度下存放48小时，统计微小牛蜱的死亡百分率并与对照作比较。

对照的死亡率<5%，而实施例11-15，17，18 和21的化合物，在浓度为300ppm或更低时的死亡率达50% 。

应用例I：对受精后发育期的雌性微小牛蜱(Boophilus microplus)(paquera品系) 的活性

将各组雌性微小牛蜱成虫(每组5 个) 浸在含有湿润剂的试验化合物的水- 丙酮溶剂分散剂中10分钟，干后放入相互隔开的塑料容器里，在25℃温度和>80%相对湿度下，放置到能够测定蜱的死亡率、产卵率和残存下来的蜱产下的卵的存活率。然后统计总的繁殖能力(即对成虫死亡的综合活性，存活率的降低和卵的死亡率)，并与对照作比较。对照的繁殖能力降低不到5%，而实施例3，11和15的化合物在浓度为500mg/l 或更低时，繁殖能力至少降低50% 。