



[12] 发明专利申请公开说明书

[21]申请号 93116448.6

[51]Int.Cl⁵

C07D401 / 12

[43]公开日 1994 年 3 月 16 日

[22]申请日 93.8.18

[30]优先权

[32]92.8.19 [33]US[31]932,397

[71]申请人 道伊兰科公司

地址 美国印第安纳

[72]发明人 B·A·德雷科恩 R·G·舒尔
P·L·约翰逊

[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 吴大建

A01N 43 / 52

说明书页数:

附图页数:

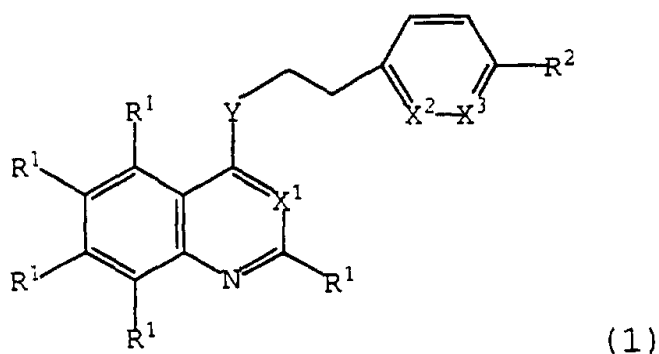
[54]发明名称 喹啉和喹唑啉的吡啶乙氧基、吡啶乙氨
基和吡啶丙基衍生物

[57]摘要

喹啉和喹唑啉的吡啶基乙氧基、吡啶基乙氨基和
吡啶基丙基衍生物, 例如 N-(2-(2-(2, 2, 2-三
氟乙氧基)-5-吡啶基) 乙基)-8-氟喹唑啉-4-胺,
它具有杀昆虫、杀螨虫、杀线虫和杀真菌的活性。

权 利 要 求 书

1. 一种结构式(1)的化合物或它的 *N*-氧化物或农艺上可接受的盐,



其中

X^1 是 *N* 或 CR^1 ;

R^1 独立地是 *H*、卤素、低级烷基、低级烷氧基、卤代烷基、卤代烷氧基、 NO_2 、 CN 或低级烷氧一羰基;

Y 是 CH_2 、 NR^3 或 *O*, 其中 R^3 选自 *H*、低级烷基、低级烷基一羰基、低级烷基一羰氧基、 SO_q -低级烷基、 SO_q -苯基或取代苯基; 而 q 是 0—2 的整数;

X^2 和 X^3 中一个是 *N* 而另一个是 CR^1 ;

R^2 是 $-Z-R^4$, 苯基或取代苯基;

Z 是 *O* 或 *S*; 以及

R^4 是 (C_1-C_4) 烷基, (C_3-C_7) 支链烷基, 卤代 (C_1-C_7) 烷基,

卤代(C_3-C_7)支链烷基, (C_1-C_4)烷氧基取代的(C_1-C_4)烷基, 或者萘基或苯基, 两者中任一个可任意地被至多 3 个选自卤素、(C_1-C_{10})烷基, 支化(C_3-C_7)烷基、卤代(C_1-C_7)烷基, 羟基(C_1-C_7)烷基, (C_1-C_4)烷氧基、卤代(C_1-C_4)烷氧基、O-苯基、O-取代苯基、苯基、取代苯基、萘基、CN、 NO_2 、OH、(C_1-C_4)链烷酰氧基或苄氧基的基团所取代。

2. 权利要求 1 的化合物, 其中 X^3 是 N。

3. 权利要求 1 的化合物, 其中 Z 是 O。

4. 权利要求 1 的化合物, 其中 R^2 是 $-Z-R^4$, Z 是 O, 和 R^4 是(C_1-C_4)支链烷基。

5. 权利要求 1 的化合物, 其中 R^2 是 $-Z-R^4$, Z 是 O, 和 R^4 是卤代(C_1-C_4)烷基。

6. 权利要求 1 的化合物, 其中 R^2 是 $-Z-R^4$, Z 是 O, 和 R^4 是在 4 位被一个卤素原子或卤代(C_1-C_4)烷基单取代的苯基。

7. 权利要求 1 的化合物, 它是 $N-(2-(2-(2,2,2-三氟乙氧基)-5-吡啶基)乙基)-8-氟喹啉-4-胺$; $4-(2-(2-(2,2,2-三氟乙氧基)-5-吡啶基)乙氧基)-8-氟喹啉$; $4-(2-(2-正丁氧基)-5-吡啶基)乙氧基)喹啉$, 或 $4-(2-(2-(1-甲基乙氧基)-5-吡啶基)乙氧基)-8-氟喹啉$ 。

8. 一种昆虫、螨虫或线虫的方法, 它包括向昆虫、螨虫或线虫抑制的栖居场所施给一种昆虫、螨虫或线虫失活量的权利要求 1

的化合物。

9. 一种抑制植物病 原体的方法，它包括向该病 原体的栖居场所施给有效量的权利要求 1 的化合物。

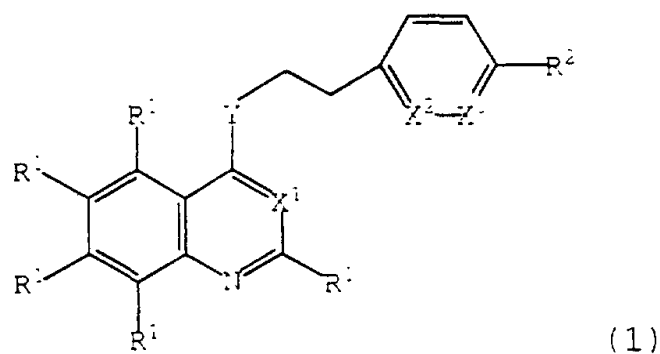
10. 一种农药组合物，它包括与一种农艺学上可接受的载体混合的昆虫、螨虫、线虫或植物病 原体抑制量的权利要求 1 的化合物。

说明书

喹啉和喹唑啉的吡啶乙氧基、
吡啶乙氨基和吡啶丙基衍生物

本发明提供新型的具有异常杀虫、杀螨、杀线虫和杀真菌活性的有机化合物。本发明还提供使用新型农药的方法和应用新型化合物的组合物。

更具体地,本发明提供结构式(1)的新型化合物:



其中

X¹ 是 N 或 CR¹;

R¹ 独立地是 H、卤素、低级烷基、低级烷氧基、卤代烷基、卤代烷氧基、NO₂、CN 或低级烷氧一羰基;

Y 是 CH₂、NR³ 或 O, 其中 R³ 选自 H、低级烷基、低级烷基—

羰基、低级烷基—羰氧基、 SO_q —低级烷基、 SO_q —苯基或取代苯基；
而 q 是 0—2 的整数；

X^2 和 X^3 中一个是 N 而另一个是 CR^1 ；

R^2 是 $-\text{Z}-R^4$ ，苯基或取代苯基；

Z 是 O 或 S ；以及

R^4 是 (C_1-C_4) 烷基， (C_3-C_7) 支链烷基，卤代 (C_1-C_7) 烷基，卤代 (C_3-C_7) 支链烷基， (C_1-C_4) 烷氧基取代的 (C_1-C_4) 烷基，或者萘基或苯基，它们两者可任意地被至多 3 个选自卤素、 (C_1-C_{10}) 烷基，支化 (C_3-C_7) 烷基、卤代 (C_1-C_7) 烷基，羟基 (C_1-C_7) 烷基， (C_1-C_4) 烷氧基、卤代 (C_1-C_4) 烷氧基、 O —苯基、 O —取代苯基、苯基、取代苯基、萘基、 CN 、 NO_2 、 OH 、 (C_1-C_4) 链烷酰基氧基 (*alkanoyloxy*) 或苄氧基的基团所取代。

本发明还提供使用新型农药的方法和应用结构式 (I) 的化合物的组合物。

贯穿本文，所有温度均以摄氏度给出，和所有的百分数是重量百分数，除非另有说明。

术语“卤素”指 F ， Cl ， Br 和 I 原子。

术语“低级烷基”指 C_1-C_6 直链烷基和 C_3-C_6 支链的和环状的烷基。

术语“低级链烯基”和“低级炔基”指含至少一个不饱和键的 C_2-C_6 直链烷基和 C_3-C_6 支链烷基。

术语“低级烷氧基”和“低级烷硫基”指 O—低级烷基和 S—低级烷基。

术语“卤代烷基”指被一个或多个卤素原子取代的低级烷基。

术语“卤代烷氧基”指被一个或多个卤素原子取代的低级烷氧基。

术语“取代苯基”指其中苯环被低级烷基、低级链烯基、低级炔基、低级烷氧基、卤素、羟基、 NO_2 、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代烷硫基、CN、苯基、取代苯基、—O—苯基、—O—取代苯基、 C_1 — C_4 链烷酰基氧基、苄氧基或 $\text{S}(\text{O})_p$ —低级烷基(这里 p 是 0—2)所取代的基团。

术语“HPLC”指高压液相色谱。

在本发明中，每当独立地选择多个取代基时，应该明白，选择它们必须使得它们彼此空间上相容。空间相容性指不存在空间位阻，这一术语在 *The Condensed Chemical Dictionary*, 7th edition, Reinhold Publishing Co., N. Y. 893 页(1966)中已定义，它的定义如下：

空间位阻。一种分子结构特征，其中该分子所具有的、它们的原子的空间排列使得与另一个分子的给定反应在速率上受到阻止或阻滞。

空间相容性，正如在 D. J. Cram 和 G. Hammon, *Organic Chemistry*, 2nd edition, Mc Graw—Hill Book Company, N. Y. 215

页(1964)中讨论的,其特征在于取代基,它们的物理体积不需要限制在不足以进行正常行为时的体积内。

某些种类的结构式(1)的化合物是优选的,即:

(1)结构式(1)的化合物,其中 R^2 是 $Z-R^4$;

(2)结构式(1)的化合物,其中 X^3 是 N ;

(3)结构式(1)的化合物,其中 X^3 是 N 和 R^2 是 $Z-R^4$;

(4)结构式(1)的化合物,其中一个 R^1 基团是 8-氟基团和其余的都是 H ;

(5)结构式(1)的化合物,其中 R^1 全部是 H ;

(6)结构式(1)的化合物,其中至少 3 个 R^1 选自 H 和 F ;

(7)结构式(1)的化合物,其中 Z 是 O ;

(8)结构式(1)的化合物,其中 X^3 是 N , R^2 是 $-Z-R^4$, Z 是 O , 和 R^4 是 (C_3-C_4) 支链烷基;

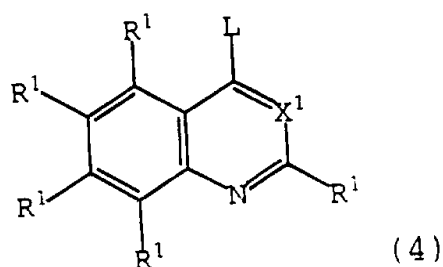
(9)结构式(1)的化合物,其中 X^3 是 N , R^2 是 $-Z-R^4$, Z 是 O , 和 R^4 是 (C_1-C_4) 烷基;

(10)结构式(1)的化合物,其中 X^3 是 N , R^2 是 $-Z-R^4$, Z 是 O , 和 R^4 是在 4 位被一个卤素原子或卤代 (C_1-C_4) 烷基单取代的苯基。

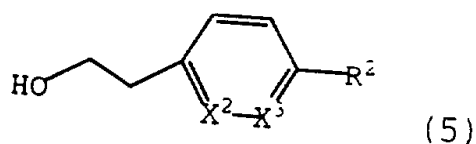
使用众所周知的化学方法制备本发明化合物。所需的起始原料是商业上可购得或使用标准方法容易合成的。

合成其中 Y 是 O 的化合物

其中 Y 是 O 的结构式(1)化合物可通过将结构式(4)



的化合物, 其中 X^1 和 R^1 是结构式(1)所定义; 和 L 是一离去基团, 如 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NO_2 、1,2,3-三唑-1-基, 1,2,4-三唑-1-基, $OSiMe_3$, 芳硫基, 烷硫基, 烷磺酰基, 芳磺酰基, 烷氧基, 或芳亚磺酰基; 与结构式(5)

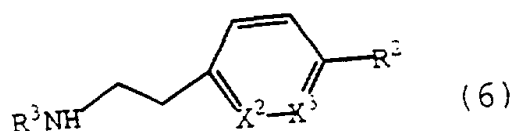


的醇, 其中 R^2 、 X^2 和 X^3 是如结构式(1)所定义, 进行缩合反应而制成。该反应优选在一种强碱如氢氧化钠存在下, 在非反应活性溶剂如 DMF 中, 在 $0-25^\circ C$ 范围的温度下进行。

合成其中 Y 是 NR^3 的化合物

其中 Y 是 NH 或 N -低级烷基的、结构式(1)的化合物是通过将如上定义的、结构式(4)的化合物与结构式(6)的胺进行缩合而制

成的,

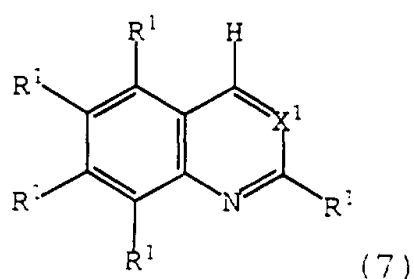


式中 R^2 、 X^2 和 X^3 是如结构式(1)定义和 R^3 是 H 或低级烷基。将结构式(4)的化合物与这种胺在 $20-180^{\circ}\text{C}$ 范围内的温度下,优选在一种酸受体如三乙胺存在下,进行反应。该反应可单纯地进行,或在一种非反应活性有机溶剂中进行。

其中 R^3 是酰基的结构式(1)的化合物是通过将其中 R^3 是 H 的胺类与酰化试剂如乙酰氯或乙酸酐反应而制得。

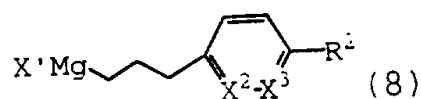
合成其中 Y 是 CH_2 的化合物

其中 Y 是 GH_2 的结构式(1)的化合物是通过将结构式(7)



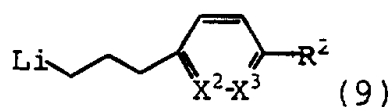
的化合物,其中 X^1 和 R^1 是结构式(1)中所定义;

与结构式(8)



的格林雅试剂，其中 R^2 、 X^2 和 X^3 是如结构式(1)中所定义，而 X^1 是卤素，进行反应而制得的。为了获得 3,4—二氢喹唑啉或喹啉，然后将其氧化。

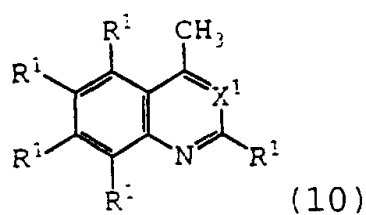
其中 Y 是 CH_2 的结构式(1)的化合物还可通过将结构式(7)的化合物与结构式(9)的锂试剂进行反应而制成。



其中 R^2 、 X^2 和 X^3 是如结构式(1)所定义。

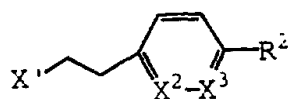
为了获得 3,4—二氢喹唑啉或喹啉，然后将其氧化。使用普通方法可从其它产物中分离出本发明所需要的化合物。典型的反应条件是那些在 *Armarego and Smith, J. Chem Soc.*, 5360 页(1965)中已描述的。

其中 Y 是 CH_2 的结构式(1)的化合物还可通过将结构式(10)的化合物，



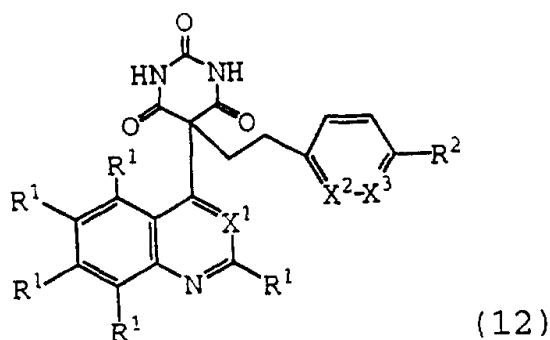
其中 X^1 和 R^1 是如结构式(1)中所定义;

与一种质子惰性的有机锂碱(尤其二异丙基酰胺锂)在极性质子惰性溶剂中反应,然后与结构式(11)的化合物



其中 R^2 、 X^2 和 X^3 是如上所定义,而 X^1 是卤素,进行反应而制得。此类反应较好地低温下,优选在 $-78-0^\circ\text{C}$ 进行。

其中 Y 是 CH_2 的结构式(1)的化合物还可由在 *J. Heterocyclic Chemistry*, Vol, 14, 1081—1083(1977)(A. Scorille 和 F. X. Smith)中描述过的本方法来制备。这种方法包括结构式(12)



的巴比土酸的水解和脱羧。其中可变取代基是如结构式(1)所定义。将巴比土酸衍生物溶于氢氧化钠和水的溶液中并回流。然后将该溶液调至偏酸性并再次回流。

以常用方式获得结构式(1)的化合物 *N*-氧化物类和盐类。

起始原料

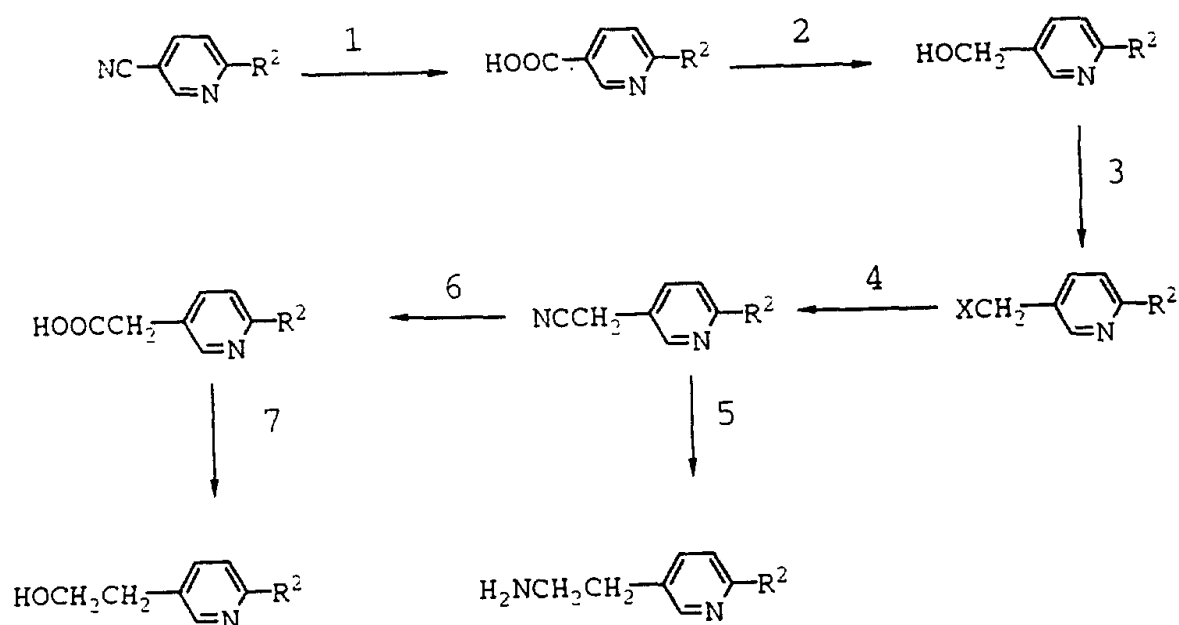
使用众所周知的方法制备结构式(4)的起始原料,例如那些在以下欧洲专利申请中的:

FPA 326,330(相应的美国专利申请号 07/334,422,1989 年 4 月 7 日申请)

EPA 326,331(相应美国专利 5,114,939)和

EPA 326,329。

使用普通方法容易制备结构式(5)的醇类和结构式(6)的胺类,例如在以下图解 I 中表示的经典链伸长方法:



在步骤 1, 腓的 KOH 水解产生相应的羧酸。

在步骤 2, 氢化锂铝还原该羧酸产生醇。此外, 这种醇可由硼氢化钠还原相应的醛而获得。

在步骤 3 中的卤化反应, 例如可以用亚硫酸氯氯化。

在步骤 4 中用 $NaCN$ 处理卤化物得到腓。

在步骤 5 是使用一种路易斯酸如 H_2SO_4 或 $AlCl_3$ 由氢化锂铝还原该腓。

在步骤 6 中, 腓的水解得到吡啶基乙酸衍生物, 它在步骤 7 中使用氢化锂铝或其它普通还原剂被还原成吡啶基乙醇。

制备 1

2-(2-(2,2,2-三氯乙氧基)-5-吡啶基)乙胺

A. 在室温将 2,2,2-三氟乙醇(11.4ml, 156mmol)滴加到氢化钠(60%在矿物油中, 5.72g, 143mmol)在 200ml DMF 中的搅拌悬浮液中。该混合物在室温搅拌约一小时, 在此期间滴加 2-氯-5-氟吡啶。所得混合物在室温搅拌约 3 小时。然后用水(约 10ml)淬灭反应, 将混合物倾入到 200ml 水中, 并用乙醚(4×200ml)萃取。这些合并的有机萃取物用水(3×200ml)洗涤, 干燥(Na_2SO_4), 过滤, 并浓缩得到 26.85g 油。将它放在硅胶塞上并洗涤, 首先用约 250ml 己烷(去除矿物油污染物), 然后用约 400ml 乙醚。除去溶剂得到 24.07g 5-氟基-2-(2,2,2-三氟乙氧基)吡啶, 为一种油。

B. 在氮气下, 将在 250ml 二氯甲烷中的 5-氯-2-(2,2,2-三氟乙氧基)吡啶 (51.41g, 0.254mol) 冷至 0℃。然后滴加 254ml (0.254mol) 氢化二异丁基铝溶液 (1.0M 在 CH_2Cl_2 中) 来处理该混合物。滴加完后, 让该混合物加热到室温并搅拌约 2 小时。该混合物然后在冰浴中冷却, 并通过滴加约 100ml 饱和氯化铵, 随后滴加 250ml 2N 硫酸而骤冷。温度保持在零下 10℃。然后将该混合物升温到室温并分离各相。水相用乙醚萃取 (2×250ml)。合并的有机萃取物用水 (1×250ml) 和饱和氯化钠 (1×250ml) 洗涤, 干燥 (Na_2SO_4), 过滤, 并浓缩得到 48.15g 2-(2,2,2-三氟乙氧基)-5-吡啶基羧醛, 为黄色固体。

C. 在氮气下于 0℃, 分批将硼氢化钠 (8.89g, 0.235mol) 加到 2-(2,2,2-三氟乙氧基)-5-吡啶基羧醛 (48.10g, 0.235mol) 在约 50ml 绝对乙醇中的溶液中。加完后, 将混合物升温到室温并搅拌约 30 分钟。将该混合物倾入到约 300ml 水中并用乙醚萃取 (3×500ml)。该合并的有机萃取物被干燥 (NaSO_4), 过滤, 并浓缩得到 47.08g (2-(2,2,2-三氟乙氧基)-5-吡啶基) 甲醇, 为黄色半固态物。

D. 在氮气下于 0℃, 将亚硫酸氯 (80ml, 1.1mol) 滴加到 (2-(2,2,2-三氟乙氧基)-5-吡啶基) 甲醇 (47.08g, 0.277mol) 在 250ml 甲苯中的溶液中。加完后, 将该混合物升温至室温并搅拌约 2 小时。在减压下除去甲苯和过剩的亚硫酸氯。将残余物收集在二氯

甲烷中并再次浓缩得到 51.03g 油,它含有某些不溶物。将该粗产物收集地乙醚(约 250ml)中并用 1N 氢氧化钠(1×150ml),水(1×150ml)和饱和氯化钠(1×150ml)洗涤。有机相被干燥(Na_2SO_4),过滤,并浓缩得到 48.87g(2-(2,2,2-三氟乙氧基)-5-吡啶基)甲基氯化物,为黄色油状物。

E. 在氮气下,在室温下,将(2-(2,2,2-三氟乙氧基)-5-吡啶基)甲基氯化物(48.86g, 0.217mmol)在 100ml DMSO 中的溶液滴加到氰化钠(31.91g, 0.651mol)在 200ml DMSO 的混合物中。加完后,该混合物被升温到 50℃,并保持在 45—50℃的温度搅拌约 2 小时。然后将混合物冷至室温,并倾入到 300ml 水中,用乙醚/二氯甲烷(2:1)进行萃取(3×300ml)。用水(2×400ml)和饱和氯化钠(1×400ml)洗涤合并的有机萃取物,然后干燥(Na_2SO_4),过滤并浓缩得到 45.19g(2-(2,2,2-三氟乙氧基)-5-吡啶基)乙腈,为深棕色油。

F. 在氮气下于 0℃,将氢化锂铝(3.70g, 92.5mmol)分批加入到被搅拌的、氯化铵(12.33g, 92.5mmol)在 150ml 乙醚中的溶液中。该混合物被搅拌约 15 分钟,然后滴加(2-(2,2,2-三氟乙氧基)-5-吡啶基)乙腈(20.00g, 92.5mmol)在 50ml 乙醚中的溶液来进行处理,加完后,将该混合物升温至室温并在室温搅拌约 2 小时。然后将该混合物在冰浴中冷却,通过滴加饱和氯化铵(约 50ml)而骤冷,用 2N 氢氧化钠调至碱性并升温至室温。所得混合

物通过过滤剂被过滤并分离各相。水相用乙醚($2 \times 200\text{ml}$)萃取。该合并的有机萃取物被干燥(Na_2SO_4),过滤,和浓缩得到 14.24g 2-(2-(2,2,2-三氟乙氧基)-5-吡啶基)乙胺,为黄色油。

制备 2

2-(2-(2,2,2-三氟乙氧基)-5-吡啶基)乙醇

A. 向(2-(2,2,2-三氟乙氧基)-5-吡啶基)乙腈(16.98g, 78.6mmol)在 120ml 二恶烷中的溶液加入 120ml 2N 氢氧化钠(240mmol),并一边搅拌一边回流 18 小时。然后将该混合物冷至室温,用 0.5N 氢氧化钠(约 100ml)稀释并用乙醚洗涤($2 \times 200\text{ml}$)。水相用浓 HCl 溶液调至 pH3 并用乙酸乙酯萃取($2 \times 200\text{ml}$)。该乙酸乙酯萃取物被干燥(Na_2SO_4),过滤,并浓缩得到 17.40g 褐色固体。从己烷/乙酸乙酯中重结晶并烘干(60°C),得到 13.24g 褐色针状形式的(2-(2,2,2-三氟乙氧基)-5-吡啶基)乙酸。M.P. 106°C 。

B. 在氮气下于 0°C , 将(2-(2,2,2-三氟乙氧基)-5-吡啶基)乙酸(24.56g, 0.104mmol)的 100ml 乙醚溶液滴加到搅拌的、氢化锂铝(4.15g, 0.104mmol)的 300ml 乙醚溶液中。加完后,将该混合物升温至室温并在室温搅拌约 2 小时。然后在冰浴中冷却该混合物,通过滴加饱和氯化铵(约 75ml)而骤冷,用 2N 氢氧化钠(约 75ml)调至碱性并升温至室温。通过过滤剂过滤所得混合物并分离各相。水相用乙醚萃取($2 \times 200\text{ml}$)。合并的有机萃取物被干燥

(Na_2SO_4), 过滤, 并浓缩得到 19.53g 2-(2-(2,2,2-三氟乙氧基)-5-吡啶基)乙醇, 为黄色油, 它快速固化结晶。M. P. 38.5°C。

实施例 1

N-(2-(2-(2,2,2-三氟乙氧基)-5-吡啶基)乙基)-8-氟代喹唑啉-4-胺

(化合物 21)

将 4-氟-8-氟喹唑啉(0.482g, 2.64mmol)、2-(2-(2,2,2-三氟乙氧基)-5-吡啶基)乙胺(0.528g, 2.4mmol) 和三乙胺(0.34ml, 2.4mmol) 在 15ml 乙醇(2B) 中的混合物的加热至回流。回流约 20 小时后, 将该混合物冷至室温, 用 75ml 二氯甲烷稀释, 用水洗涤(2×50ml), 用饱和氯化钠溶液洗涤(1×50ml), 干燥(Na_2SO_4), 过滤, 并浓缩得到 0.90g 褐色固体。在硅胶上进行色层分离, 用己烷/乙酸乙酯(20/80)洗脱。离析出主产物得到 0.68g 淡褐色固体。从己烷/乙酸中重结晶, 并干燥, 得到 0.443g 白色固体。M. P. 174°C。

实施例 2

4-(2-(2-正丁氧基-5-吡啶基)乙氧基)
喹唑啉

(化合物 3)

在氮气下于室温, 将以在矿物油中的 60% 分散体形式的氢

化钠(0.120g, 3.0mmol)分批加入到 2-(2-正丁氧基-5-吡啶基)乙醇(0.586g, 3.0mmol)的 10ml DMF 溶液中。这种混合物被搅拌约 10 分钟。然后,分批加入 0.494g(3.0mmol)4-氯喹唑啉,该混合物在室温下搅拌 4 小时。然后将该混合物倾入到 50ml 水中并用乙醚/二氯甲烷(2:1)溶液萃取(4×50ml)。合并的有机萃取物用水(3×50ml)和饱和氯化钠溶液(1×50ml)洗涤,然后干燥(Na_2SO_4)过滤,并浓缩得到 1.02g 黄色固体。在硅胶上进行色层分离,用己烷/乙酸乙酯(90/10)洗脱。合并含主要产物的级分,并浓缩,得到 0.423g 无色油。

下表 I 鉴定结构式(1)的代表性化合物,它们是实际上使用上述方法而制备的。

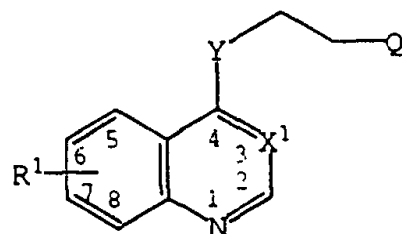


表 I 化合物鉴定

化合物	X ¹	Y	R ¹	Q	MP °C
1	CH	NH	8-F	2- 正丁氧基-5-吡啶基	116
2	CH	O	8-F	" "	87
3	N	O	H	" "	oil
4	N	O	8-F	" "	57
5	N	NH	H	" "	147
6	N	NH	8-F	" "	156
7	CH	NH	8-F	2- 异丙氧基-5-吡啶基	164
8	N	NH	H	" "	180
9	N	NH	8-F	" "	172
10	N	O	H	" "	oil
11	N	O	8-F	" "	258
12	CH	O	8-F	" "	oil
13	N	NH	8-F	2- ((2-甲氧基乙基)-氧基)-5-吡啶基	131
14	N	NH	H	2- " "	123
15	CH	NH	8-F	2- " "	115
16	CH	NH	8-F	2- ((2, 2, 2-三氟-乙基)氧基)-5-吡啶基	204
17	N	NH	H	" "	156
18	N	O	H	" "	60
19	CH	O	8-F	" "	126
20	N	O	8-F	" "	82
21	N	NH	8-F	" "	174
22	N	O	6-F	" "	89
23	N	O	7-F	" "	91
24	N	O	6, 7-F ₂	" "	117
25	N	NH	8-F	" "	161

表I (续)

化合物	X ¹	Y	R ¹	Q	MP °C
26	CH	O	8-F	2-((2,2,2-三氟-1-甲基乙基)氧基-5-吡啶基	oil
27	N	O	H	" "	oil
28	N	O	8-F	" "	oil
29	N	O	6-F	" "	oil
30	N	NH	6-F	" "	oil
31	N	NH	8-F	" "	147
32	N	NH	H	" "	130
33	N	NH	H	2-((2,2,3,3-四-氟丙基)氧基)-5-吡啶基	123
34	N	NH	8-F	" "	150-152
35	CH	NH	8-F	" "	155
36	N	O	H	" "	oil
37	N	O	8-F	" "	oil
38	CH	O	8-F	" "	107
39	N	O	8-F	5-苯基-2-吡啶基	113
40	N	O	H	" "	53
41	N	O	8-F	2-苯基-5-吡啶基	50-53
42	N	O	H	2-((4-氯苯基)氧基)-5-吡啶基	76

表I (续)

化合物	X ¹	Y	R ¹	Q	MP °C
43	N	O	8-F	2-((4-氯苯基)氧基)-5-吡啶基	131
44	CH	O	8-F	" "	156
45	CH	NH	8-F	" "	184
46	N	NH	H	" "	163
47	N	NH	8-F	" "	180
48	CH	NH	8-F	2-((4-三氟甲基-苯基)氧基)-5-吡啶基	149
49	N	NH	H	" "	169
50	N	NH	8-F	" "	175
51	CH	O	8-F	" "	112
52	N	O	8-F	" "	74
53	N	O	H	" "	102
54	N	O	H	2-((4-甲基苯基)-硫基)-5-吡啶基	127
55	CH	O	8-F	2-((3-三氟甲基-苯基)硫基)-5-吡啶基	144
56	N	NH	H	" "	148-149
57	N	O	H	" "	oil
58	N	NH	8-F	" "	142
59	N	O	6-CH ₃	2-((2,2,2-三氟乙基)氧基)-5-吡啶基	

杀真菌活性

本发明化合物被发现用来控制真菌,特别是植物病原体。当用于治理植物真菌性病害时可将该化合物以病害抑制和植物学上可接受的量施予这些植物。这里所用的术语“病害抑制和植物学上可接受的量”指本发明化合物足以消灭和抑制所需控制的植物病害,但不明显毒害植物的用量。该用量一般在约1—1000ppm,优选10—500ppm。所需化合物的准确浓度将随所要控制的真菌性病害,所用配制剂类型,使用方法,特殊的植物种类,气候条件,等等而变化。适宜的使用比率一般在0.25—4 lb/A的范围。本发明化合物还可用于保护贮存的谷物和其它非植物场所以免遭真菌侵害。

被控制的代表活性真菌病害生物体包括:

甘蓝格链孢 (芸苔属植物叶斑病)

mali 链格孢 (苹果叶斑病)

细链格孢 (叶斑病)

灰葡萄孢 (灰霉病)

Sativus 旋孢 (斑枯)

咖啡毛盘孢 (咖啡浆果病)

Colletotrichum Lindemuthianum (炭疽病)

大麦白粉菌 (大麦白粉病)

小麦白粉菌 (小麦白粉病)

大镰刀孢菌	(穗疫病)
菜豆尖孢镰刀菌	
<i>Gerlachia nivalis</i>	(雪霉病)
<i>nodorum</i> 小球腔菌	(颖霉斑)
柑桔生疫霉	
寄生疫霉	(黑胫病)
葡萄生单轴霉	(葡萄霜霉病)
苹果白粉病菌	(苹果白粉病)
蔓毛壳植物假小白尾孢	(禾谷眼点)
隐匿柄锈菌	(叶锈病)
圆核腔菌	(网斑病)
<i>Pyricularia oryzae</i>	(稻瘟病)
终极腐霉	(潮湿腐烂病)
谷物丝核菌	(小麦尖眼点)
立枯丝核菌	(叶鞘瘟病)
黑麦喙孢	(叶片褐斑病)
小麦壳针孢	
齐整小核菌	(白斑腐)
核盘菌	
<i>Uncinula necator</i>	(葡萄白粉病)
玉蜀黍黑粉菌	(小麦腥黑粉病)

albo-atrum 轮枝孢菌

(番茄枯萎)

不等黑星菌

(苹果黑星病)

以下实验用于评价表 I 所鉴定的化合物在抵抗各种不同的、引起植物病害的生物体时的效力。

这些试验化合物通过将 50mg 该化合物溶于 1.25ml 溶剂中而配制使用。该溶剂是通过将 50ml“吐温 20(*Tween* 20)”(聚氧乙烯(20)脱水山梨糖醇单月桂酸酯浮化剂)与 475ml 丙酮和 475ml 乙醇混合而制成的。该溶剂/化合物溶液用去离子水稀释至 125ml。所得配制剂含有 400ppm 试验化合物。通过用溶剂—表面活性剂混合物连续稀释获得较低浓度。

这些配制的试验化合物通过叶面喷洒而施用。使用了下列植物病原体或它们相应的植物。

病原体	在表 II 中的代号	宿言
小麦白粉菌(白粉病)	<i>ERYSGT</i>	小麦
<i>pyricularia oryzae</i> (稻瘟病)	<i>PYRIOR</i>	稻
小麦隐匿柄锈菌 (叶锈病)	<i>PUCCRT</i>	小麦
<i>Leptosphaeria nodorum</i>	<i>LEPTNO</i>	小麦

(颖霉斑)

葡萄生单轴霉(霜霉病)

PLASVI

葡萄

将配制的专门化合物喷洒在宿主植物的所有叶面上至溢流。
单盆每种宿主植物被置放在通风橱中突起的旋转托架上。将试验溶液喷洒在所有叶面上。所有的处理允许干燥并且这些植物用合适的病原体在 24 小时内进行接种培养。

当以这种试验评价时,表 II 列举了本发明典型化合物的活性。
使用以下等级评估试验化合物控制病害的效果。

0=未对特定的生物体试验

—=在 400ppm 控制 0—19%

+=在 400ppm 控制 20—89%

++=在 400ppm 控制 90—100%

+++ =在 100ppm 控制 90—100%

表 II：杀真菌活性

化合物	ERYSGT	PYRIOR	PUCCRT	LEPTNO	PLASVI
1	++	++	++	+	++
2	+++	++	+++	++	++
3	+++	+++	+++	++	+++
4	+++	+++	+++	++	+++
5	+++	++	+++	+	+++
6	+++	++	+++	-	+++
7	+	-	+	-	-
8	-	-	-	-	-
9	+++	-	+++	-	-
10	+++	-	+++	++	+
11	+++	+	+++	++	+
12	+++	+	+++	++	+
13	++	+++	+++	+	+++
14	+	++	+++	++	+++
15	+	+	+++	++	+++
16	++	+	+++	+++	++
17	+++	+	+++	-	+
18	+++	+++	+++	-	+
19	+++	++	+++	-	+
20	+++	++	+++	++	+++
21	+++	++	+++	+	+++
22	+++	-	+++	-	+
23	+++	+++	+++	-	+++
24	-	-	++	-	++
25	-	+	+	-	+
26	++	++	++	-	+
27	++	++	++	-	++
28	++	++	++	+	++
29	++	++	++	++	++
30	-	+	++	-	++
31	-	++	++	+	++
32	-	+	++	+	++
33	-	+	+	+	+++
34	++	+	+++	+	+++
35	++	+	+++	-	+++

表 II (续)

化合物	ERYSGT	PYRIOR	PUCCRT	LEPTNO	PLASVI
36	+++	++	+++	-	+++
37	+++	++	+++	++	+++
38	+++	+	+++	-	+++
39	+++	+++	+++	++	+++
40	+++	+++	+++	++	++
41	+++	+++	+++	--	+++
42	+++	+++	+++	--	+++
43	+	-	+++	-	+
44	+	+	++	-	+
45	-	-	+	-	++
46	-	+	++	+	-
47	++	+	+++	+	+++
48	++	+++	+++	++	+++
49	+++	++	+++	++	+++
50	+++	+	+++	++	+++
51	+++	+	+++	+++	+++
52	+++	+++	+++	++	+++
53	+++	+++	+++	++	+++
54	+	-	-	-	++
55	++	-	+++	-	++
56	+	-	+	-	-
57	++	+	+++	-	++
58	++	+++	+++	-	+++
59	++	++	++	+	

杀虫活性

结构式(1)的化合物表现出抵抗许多昆虫、螨虫和线虫的活性。更具体地,该化合物表现出抵抗棉蚜的活性,棉蚜是同翅目昆虫中的一员。同翅目的其成员包括叶蝉,光蝉,梨黄木虱,革木虱,介壳虫、粉虱,沫虫以及许多其它宿主所特定的蚜虫种类。还观察到了抵抗温室蓟马的活性,这些蓟马是缨翅目中的成员。该化合物还表现出抵抗南方粘虫的活性,它是鳞翅昆虫中的一员。这一目中的其它典型的成员是果蠹蛾,糖蛾,衣蛾,印度谷螟,豆荚卷叶螟,玉米穗夜蛾,欧洲玉米螟,菜粉蝶,粉纹夜蛾,棉铃虫,蓑蛾幼虫,东方天幕蛾,甜菜粘虫,烟青虫,草地野螟,和秋粘虫。该化合物还表现出抵抗德国小蠊的活性,它是直翅目中的成员。这一目中的其它典型成员是亚洲蜚蠊,东方蜚蠊,美国大蠊,笨蝗(魔蝗),殊种蚱蜢,赤腿蚱蜢,迁徙蚱蜢,美洲蚱蜢,游移蚱蜢,和室内蟋蟀。该化合物还表现出抵抗玉米根虫的活性,它是鞘翅目中的一员。这一目中的其它典型成员是西方黄瓜十二星叶甲,科罗拉多马铃薯甲虫,杂拟谷盗,墨西哥豆瓢虫,梅球颈象,埃及苜蓿象甲,苜蓿叶象虫,稻象虫,南方玉米象虫,棉(铃)象(鼻)虫,和甘薯象虫。

结构式(1)的化合物有用于减少昆虫、螨虫和线虫种群并且以一种抑制昆虫、螨虫或线虫的方法被应用,该方法包括向该昆虫、螨虫或线虫的栖居场所 施给有效的昆虫、螨虫或线虫致死量的结构式

(1) 的化合物。这里所使用的术语昆虫、螨虫或线虫的“栖居场所”意指这些昆虫、螨虫或线虫生活或它们的卵存在之环境,包括它们周围的空气,它们的食物,它们生存的土地,或它们接触的物体。例如可通过向昆虫或螨虫吃的植物部分(特别是叶子)施给该活性化合物而控制吃植物的昆虫或螨虫。还可以想到,通过向织物、纸张,贮存的粮食,或种子施给活性化合物,该化合物或许能保护它们。术语“抑制昆虫,螨虫,或线虫”指活着的昆虫,螨虫或线虫在数量上的减少;或者能生存的昆虫,螨虫或线虫的卵在数量上的减少。当然,由化合物所达到减少程度,取决于该化合物的使用比率,所使用的特定化合物,和目标昆虫、螨虫或线虫种类。应使用至少一种昆虫失活,螨虫失活或线虫失活量,术语“昆虫失活量”,“螨虫失活量”和“线虫失活量”被用来描述一种用量,它足以使被处理的昆虫、螨虫或线虫得到可测量的减少。一般采用在约 1—约 1000ppm 活性化合物范围内的用量。

测试了表 I 中所鉴定的化合物抵抗八个种类的杀螨虫和杀昆虫活性。结果列举在表 III,在表 III 中使用以下简写:

ALH	指	紫菀叶蝉
BAW	指	甜菜粘虫
CA	指	棉蚜虫
NEM	指	花生根癌线虫
SCRW	指	南方玉米根虫

TBW	指	烟青虫
TSSM	指	二点叶螨
GECR	指	德国小蠊

在进行杀虫活性的评估时，每一种试验化合物被配制成 400ppm 溶液，然后用水稀释该溶液得到较低浓度。该 400ppm 溶液是通过将 19.2ml 0.05% 的 Tween 20(聚氧乙烯 (20)脱水山梨糖醇单月桂酸酯) 在水中的溶液与 8mg 该化合物在 0.8ml 丙酮/乙醇 (9/1) 中的溶液混合而制成的。

抵抗紫菀叶蝉 (*Macrostelus fascifrons*) 的活性被测试如下。使用 400ppm 和 50ppm 的浓度进行测试。使用一个平扇形喷嘴用 0.4ml 配制好的原料喷洒装有一个棉芯的一盎司塑料杯。让多余的水分挥发。然后向每一只杯子加入 5 到 10 个被二氧化碳麻醉的叶蝉成虫。盖上这些杯子，并在室温下存放 24 小时。然后测定死亡百分率。

抵抗甜菜粘虫 (*Spodoptera exigua* 甜菜灰翅夜蛾) 的活性被评估如下。使用 400ppm 和 50ppm 的浓度进行该试验。用 5% 无营养琼脂将一般目的的鳞翅目人造食物稀释到半强度。8ml 这种食物原料被分配到一盎司食物杯中。处理前的一个小时，将 35—40 个卵分配到该食物的表面。然后通过一个平扇形喷嘴用配制好的原料喷洒这些杯子。被处理的杯子经空气干燥后，用塑料盖子封上。这些杯

子在室温下存放6天。然后以活的和死的幼虫总数为基础,和以活幼虫的大小为基础来估算活性。

抵抗棉蚜虫(*Aphis gossypii*)和二点叶螨(*Tetranychus urticae*)的活性被评估如下。将金黄弯脖子南瓜植株生长到展子叶阶段(约6—8天)。在使用试验原料之前,通过移入从原种群(a stock colony)切下的被侵害了的叶子而让棉蚜虫和二点叶螨侵害这些植株16—24小时。从这些南瓜植株中拿走移入的叶子之后,立即喷洒施用该试验原料。使用400ppm的浓度进行试验。使用雾化喷雾器将试验溶液以17磅/英寸的压力喷洒这些植株。这些叶子的两面被覆盖直至溢流然后风干。在处理的三天之后,测每一种化合物的活性。按照以存在于仅用溶剂喷洒过的植株上的螨虫/蚜虫为基础的百分数来计算活性。

抵抗花生根癌线虫(*Meloidogyne arenaria* 蚤缀根结线虫)的活性被评估如下。将5粒未处理的黄瓜种子放入一个清洁的一盎司杯子的底部,加入20干净的白沙,杯子一边在托架上旋转,一边向其中喷洒以使1.0ml 400ppm溶液沉积在沙子上。向每一只杯子分配2.5—3.0ml含有300—500条线虫的去离子水。这些杯子在温度为76—85℃和环境湿度为50—60%的环境生长室存里放10—12天。10—12天后,通过翻转杯子,观察线虫死亡率和对黄瓜植株造成的损害,来评估这些杯子。

抵抗南方玉米根虫(*Diabrotica undecimpunctata howardi* Bar-

ber 黄瓜十一星叶甲) 的活性被评估如下。将 1 毫升含有预定浓度试验化合物的试验溶液加到其中的 16g 无菌土中含一粒玉米种子的杯子中。这样得到 24ppm 的土壤浓度。经 1.5—2 小时干燥后, 将 5 只第 4 蜕期的玉米根虫的幼虫加到杯子中。在第 3—4 天通过将杯子倒空在一盘上并检查土壤中活根虫来测死亡率。

抵抗烟青虫 (*Heliothis virescens*, 烟芽夜蛾) 的活性被评估如下。用 5% 无营养琼脂将一般目的和鳞翅目人造食物稀释至半强度。将 8ml 这种食物原料分配到每一个一盎司食物杯中。在处理前的 1 小时将 18—20 卵分配到食物表面。然后, 通过一平扇形喷嘴用配制的原料向这些杯子喷洒。使用 400ppm 和 50ppm 的浓度进行该试验。被处理的杯子被风干之后, 用塑料盖子封上。这些杯子在室温存放 6 天。然后以活的和死的幼虫的总数为基础, 和以活幼虫的大小为基础来估算活性。

抵抗德国小蠊 (*B lattella germanicus* 德国小蠊) 的活性被评估如下。8ml 以苜蓿为基的嫩绿昆虫食物原料被分配到一只盎司食物杯中。通过一平扁形喷嘴用配制原料向这些杯中喷洒。使用 400ppm 和 50ppm 的浓度进行该试验。这些被处理的杯子经风干 24 小时, 然后用 5 只晚第三或早第四期的德国小蠊侵害。封上这些杯子并在温度为 76—85℃ 的环境生长室中存放十天。然后以活的和死的昆虫总数为基础来估算活性。

表 III：杀昆虫、杀线虫和杀螨虫活性

化合物	ALH	BAW	CA	NEM	SCRW	TBW	TSSM	GEGR
	400	400	400	400	400	400	400	400
	ppm	ppm	ppm	ppm	ppm	ppm	ppm	ppm
	50	50	50	50	50	50	50	50
	ppm	ppm	ppm	ppm	ppm	ppm	ppm	ppm
1	100	100	100	0	0	100	100	0
	50	60	85	0	-	80	90	-
2	100	100	0	100	0	100	0	40
	100	100	0	100	-	90	0	-
3	100	100	100	100	100	100	100	60
	100	100	100	100	-	0	100	-
4	100	100	100	100	100	80	100	40
	100	100	100	100	-	80	100	-
5	30	100	100	100	100	80	100	40
	100	100	100	100	-	0	100	-
6	100	100	100	100	100	100	100	40
	0	100	100	100	-	0	100	-
7	100	100	0	0	0	100	0	20
	-	-	-	-	0	-	-	-
8	100	100	0	100	0	100	0	0
	-	-	-	-	-	-	-	-
9	80	100	0	100	0	100	0	0
	-	-	-	-	-	-	-	-
10	100	100	100	100	100	100	100	0
	-	-	-	-	-	-	-	-
11	60	100	100	100	100	100	100	0
	-	-	-	-	-	-	-	-
12	100	100	100	100	100	100	100	0
	-	-	-	-	-	-	-	-
13	100	100	40	0	0	100	60	20
	100	90	0	-	-	30	0	0
14	100	100	0	0	0	100	0	0
	100	100	0	-	-	0	0	0
15	100	100	0	0	0	100	0	0
	100	90	0	-	-	100	0	0
16	100	100	80	0	0	100	0	20
	-	-	-	-	-	-	-	-
17	100	100	100	80	0	100	100	20
	-	-	-	-	-	-	-	-
18	100	100	100	100	100	100	100	40
	-	-	-	-	-	-	-	-
19	100	100	100	100	0	100	100	20
	-	-	-	-	-	-	-	-

表 III (续)

化合物	ALH 400 ppm 50 ppm	BAW 400 ppm 50 ppm	CA 400 ppm 50 ppm	NEM 400 ppm 50 ppm	SCRW 400 ppm 50 ppm	TBW 400 ppm 50 ppm	TSSM 400 ppm 50 ppm	GEGR 400 ppm 50 ppm
20	100	100 -	100 -	100 -	100 -	100 -	100 -	0 -
21	100	100 -	100 -	100 -	100 -	100 -	100 -	20 -
22	100 100	100 100	100 100	0 0	100 0	100 80	100 100	80 -
23	0 0	0 0	100 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 -
24	0 0	100 100	0 0	0 -	0 -	30 20	0 0	0 0
25	80 60	0 0	0 0	- -	0 -	80 0	0 0	0 0
26	100 80	100 100	100 0	100 -	0 -	100 100	100 100	40 20
27	100 80	100 100	100 100	100 -	100 -	100 100	100 100	20 0
28	100 100	100 100	100 100	100 -	100 -	100 100	100 100	40 0
29	100 100	100 100	100 100	0 -	100 -	100 40	100 100	100 0
30	100 -	100 100	0 0	100 -	100 -	100 100	0 0	20 0
31	100 -	100 100	100 100	100 -	100 -	100 100	100 100	20 0
32	100 -	100 100	100 100	100 -	100 -	100 100	100 100	20 0
33	100 100	100 100	0 0	80 20	0 -	100 100	0 0	20 0
34	80 100	100 100	100 100	100 80	0 -	100 100	100 100	60 0
35	100 100	100 100	100 30	100 100	0 -	100 100	90 0	20 0
36	100 100	100 100	100 100	100 100	0 -	100 100	100 100	0 0
37	100 100	100 100	100 100	100 100	0 -	100 100	100 100	80 40
38	100 100	0 100	100 100	100 100	0 -	100 100	100 100	40 -

表 III (续)

化合物	ALH 400 ppm 50 ppm	BAW 400 ppm 50 ppm	CA 400 ppm 50 ppm	NEM 400 ppm 50 ppm	SCRW 400 ppm 50 ppm	TBW 400 ppm 50 ppm	TSSM 400 ppm 50 ppm	GEGR 400 ppm 50 ppm
39	0 0	100 100	0 0	0 -	0 -	100 30	0 0	0 20
40	100 100	100 100	80 -	0 -	0 -	100 0	100 -	0 -
41	100 100	100 100	0 0	100 -	100 -	100 100	0 0	100 0
42	100 100	100 100	100 100	0 0	100 -	100 100	100 100	40 0
43	100 100	100 100	0 0	0 0	0 0	100 100	0 0	80 0
44	100 100	100 100	100 100	0 0	0 0	100 100	10 0	0 0
45	100 100	100 100	0 0	0 0	0 -	100 100	0 0	60 0
46	100 100	100 100	90 50	0 0	0 -	100 100	100 100	40 0
47	100 100	100 100	100 100	100 0	100 -	100 100	100 100	40 40
48	0 100	100 50	0 0	0 0	0 -	100 100	0 0	0 0
49	100 50	100 100	100 100	100 0	100 -	100 100	100 100	0 0
50	100 100	100 100	100 100	100 0	100 -	100 100	100 100	0 20
51	100 100	100 100	100 90	100 0	100 -	100 100	0 0	0 0
52	100 100	100 100	100 100	100 0	100 -	100 100	100 100	100 -
53	100 100	100 100	100 100	100 0	0 -	100 100	100 100	20 -
54	-	-	0	-	0	-	0	-
55	80 50	0 0	0 0	0 0	0 0	40 0	0 0	0 -
56	0 -	0 -	0 -	0 -	0 -	0 -	0 -	0 -
57	0 -	30 -	90 -	0 -	0 -	0 -	100 -	0 -
58	- -	0 -	100 -	0 -	0 -	100 -	100 -	0 -

组合物

结构式(1)的化合物以组合物的形式被应用,而该组合物是本发明的重要实施方案,这包括结构式(1)的一种化合物和植物学上可接收的一种惰性载体。该组合物或者是分散在水中使用的浓缩配制剂,或者是不需进一步处理而使用的粉状或颗粒状配制剂。该组合物可根据农业化学技术中常用的方法和配方而制备,但它们是新颖的和重要的,因为其中存在本发明化合物。然而,我们将给出该组合物配方的一些描述,以确保农业化学家们能容易在制备出任何所需的组合物。

其中使用这些化合物的分散液通常是由这些化合物的浓缩配制剂而制成的含水悬浮液或乳液。这些水可溶的、水可悬浮的或可乳化的配制剂,或者是平常已知的为可润湿粉末的固体,或者是平常已知为可乳化浓缩或含水悬浮液的液体。可以被压制形成水可分散颗粒的可润湿粉剂包括该活性化合物,一种惰性载体和表面活性剂的紧密混合物。活性化合物的浓度通常在约10%—约90%(重量计)。惰性载体通常可从硅镁土、蒙脱土、硅藻土或纯化硅酸盐中选择。可润湿粉剂中约0.5%—10%的有效表面活性剂是从磺化木质素、缩合萘磺酸盐、萘磺酸盐、烷基苯磺酸盐、烷基硫酸盐和非离子表面活性剂如烷基酚类的环氧乙烷加合物中寻找。

该化合物的可乳化的浓缩液包括适宜浓度的化合物,如每升液

体约 50—约 500 克(相当于约 10%—约 50%),该化合物被溶于惰性载体中,该载体或者是水混溶性溶剂,或者是水不可混溶性有机溶剂和乳化剂的混合物。有用的有机溶剂包括芳香烃类(尤其是二甲苯类)和石油馏分(尤其是石油的高沸点萘属或烯属部分如重芳香石脑油)。还可使用其它有机溶剂,如萜烯类溶剂(包括松香衍生物),脂肪酮类(如环己酮)和复杂醇类(如 20 乙氧基乙醇)。可乳化浓缩液的合适乳化剂是选自普通的非离子表面活性剂,例如以上所讨论过的。

含水悬浮液包括本发明的水不溶化合物的悬浮液,该化合物以在约 5%—约 50%(重量)范围的浓度分散在含水载体中。悬浮液是通过细磨该化合物并将它强烈地混合到包括水和选自上述同样类型的表面活性剂的载体中而制备的。为提供含水载体的密度和粘度,还可加入惰性组分如无机盐类和合成的或天然的树胶。通过制备含水混合物并在一器具如混砂机、球磨机或活塞型均化器中使它均化,通常能够在同一时间最有效地磨细和混合该化合物。

该化合物还可以颗粒状组合物形式被施用,这种组合物特别有用于土壤施用。颗粒状组合物通常含约 0.5—约 10%(重量)的该化合物,该化合物分散在全部或大部分由粘土或类似的廉价物质组成的惰性载体中。此类组合物通常是通过将该化合物溶于合适的溶剂中并将其施加于被预先制成合适颗粒尺寸(在约 0.5—3mm 的范围)的颗粒状载体而制得。此类组合物还可通过将载体和化合物制

成生面团或糊状,以及碾碎和干燥以获得所需颗粒尺寸而配制。

包含该化合物的粉剂是简单地通过将粉末形式的该化合物与适宜的粉末状农用载体如高岭土,磨细的火山石及类似物进行紧密混合而制成的。粉剂可较合适地含约1%—约10%的该化合物。

出于任何理由,以在合适有机溶剂中的溶液形式使用该化合物同样是可行的,这种溶剂通常是无刺激性气味的石油如广泛用于农业化学的喷淋油。

杀虫剂和杀螨剂通常以活性成分在液体载体中的分散液的形式使用。根据活性成分在载体中的浓度来表示应用比率是普通的。最广泛使用的载体是水。

结构式(1)的化合物还可以烟雾剂组合物的形式被施用。在这些组合物中,活性化合物溶解或分散在惰性载体中,这种载体是产生压力的推进剂混合物。该烟雾剂组合物装在一个容器中,通过雾化阀将该组合物从容器中喷洒出来。推进剂混合物或者包括低沸点卤化碳类(可与有机溶剂混合)或者包括用惰性气体或气态烃类加压的含水悬浮液。

施加到昆虫和螨虫所在场所的化合物的实际用量并不是严格的,并且它可由本技术领域的熟练人员鉴于上述实施例来确定。一般来说,化学物以10ppm到5000ppm的浓度就可有希望获得好的控制效果。对于许多这些化合物。100—1500ppm的浓度就可满足需要。对于农作物如大豆和棉花,化合物合适的施用比率是约0.5—1.5磅

/亩(1b/A),典型地以 50 加仑/亩(gal/A)的含 1200—3600ppm 化合物的喷 雾配制剂来施用。对于柑橘作物,合适的使用比率是约 100—1500 加仑/亩(gal/A)的喷 雾配制剂,它是 100—1000ppm 的比率。

施加化合物的场所可以是昆虫或蜘蛛栖居的任何场所,例如,蔬菜作物,水果和坚果树,葡萄和装饰植物。由于许多螨虫种类是相对于特殊宿主所特定的,前面所列螨虫种类提供了宽 范围环境的例子,在这些环境中可使用本发明的化合物。

由于螨虫卵具有抵抗毒物作用的特殊本领,需要重复施用以控制新出现的幼虫,而这对于其它已知的杀螨剂也是一样的。

本 发明的化合物的以下配方是典型的、用于实施本发明的组合物。

A. 可乳化浓缩物

结构式(1)的化合物	9.38%
“TOXIMUL D” (非离子/阴离子表面活性剂混合物)	2.50%
“TOXIMUL H” (非离子/阴离子表面活性剂混合物)	2.50%
“EXXON 200” (萘属溶剂)	85.62%

B. 可乳化浓缩物

结构式(1)的化合物	18.50%
“TOXIMUL D”	2.50%
“TOXIMUL H”	2.50%
“EXXON 200”	76.50%

C. 可乳化浓缩物

结构式(1)的化合物	12.50%
N-甲基吡啶 烷酮	25.00%
“TOXIMUL D”	2.50%
“TOXIMUL H”	2.50%
“EXXON 200”	57.50%

D. 含水悬浮液

结构式(1)的化合物	12.00%
“PLURONIC P-103” (环氧丙烷和环氧乙烷的嵌段共聚物, 表面活性剂)	1.50%
“PROXEL GXL” (生物杀伤剂/防腐保存剂)	0.05%
“AF-100” (硝消泡剂)	0.20%

“REAX 88B”	1.00%
(木质素磺酸盐分散剂)	
丙二醇	10.00%
铝硅酸镁盐	0.75%
合成生物聚合胶(Xanthan)	0.25%
水	74.25%

E. 含水悬浮液

结构式(1)的化合物	12.50%
“MAKON 10”	1.00%
(10 摩尔氧化乙烯壬基 酚表面活性剂)	
“ZEOSYL 200”	1.00%
(硅石)	
“AF—100”	0.20%
“AGRIWET FR”	3.00%
(表面活性剂)	
2%合成生物聚合胶水合物	10.00%
水	72.30%

F. 含水悬浮液

结构式(1)的化合物	12.50%
“MAKON 10”	1.50%

“ZEOSYL 200”(硅石)	1.00%
“AF—100”	0.20%
“POLYFON H”	0.20%
(木质素磺酸盐分散剂)	
2%合成生物聚合胶水合物	10.00%
水	74.60%

G. 含水悬浮液

结构式(1)的化合物	10.20%
“TERGITOL TMN—6”	3.40%
“ZEOSYL 200”	0.90%
2%“KELZAN”溶液	8.60%
“AF—100”	0.20%
水	76.70%

G. 可润湿的粉剂

结构式(1)的化合物	25.80%
“POLYFON H”	3.50%
“SELLOGEN HR”	5.00%
“STEPANOL ME DRY”	1.00%
阿拉伯胶	0.50%
“HISIL 233”	2.50%

巴顿土	61.70%
<i>H.</i> 粒剂	
结构式(1)的化合物	5.0%
丙二醇	5.0%
<i>EXXON</i> 200	5.0%
<i>FLorex</i> 30/60 粒状土	85.0%