



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 105123738 A

(43) 申请公布日 2015. 12. 09

(21) 申请号 201510487599. 0

A01P 17/00(2006. 01)

(22) 申请日 2010. 10. 18

(62) 分案原申请数据

201010510326. 0 2010. 10. 18

(71) 申请人 江苏扬农化工股份有限公司

地址 225009 江苏省扬州市文峰路 39 号

申请人 江苏优士化学有限公司

(72) 发明人 戚明珠 周景梅 贾炜 赵建伟

杨建文 孙鹏 苏恩鹏

(74) 专利代理机构 北京万科园知识产权代理有

限责任公司 11230

代理人 张亚军 夏新

(51) Int. Cl.

A01N 53/06(2006. 01)

A01N 25/12(2006. 01)

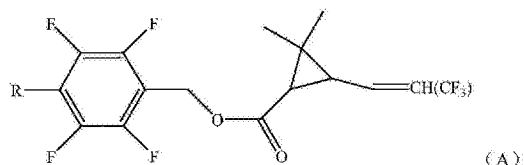
权利要求书1页 说明书7页 附图1页

(54) 发明名称

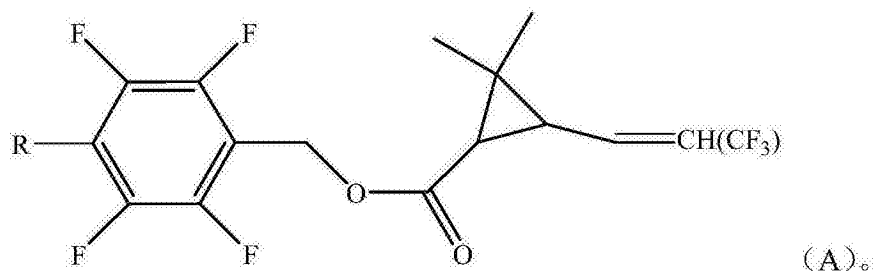
一种害虫驱避粉剂及其应用

(57) 摘要

本发明提供一种害虫驱避粉剂, 它由占害虫驱避粉剂总重量 0. 01 % ~ 5 % 的驱虫有效成分和余量的粉状载体组成, 所述驱虫有效成分为下式所示的拟除虫菊酯化合物 A, 其中 R 为氢原子或甲氧基甲基; 所述的粉状载体是农药学上可接受的能载荷或稀释农药的惰性成分。本发明所述的害虫驱避粉剂能够有效抑制爬行害虫和飞行害虫的侵扰, 并且药效持久。本发明还提供所述害虫驱避粉剂的应用。



1. 一种害虫驱避粉剂,其特征在于,它由占害虫驱避粉剂总重量 0.01%~5%的驱虫有效成分和余量的粉状载体组成,所述驱虫有效成分为下式所示的拟除虫菊酯化合物 A,其中 R 为氢原子或甲氧基甲基;所述的粉状载体是农药学上可接受的能载荷或稀释农药的惰性成分



2. 权利要求 1 所述的害虫驱避粉剂,其特征在于:所述的拟除虫菊酯化合物中, R 为甲氧基甲基,即化合物 A 为 2,3,5,6-四氟-4-甲氧基甲基苄基-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯。

3. 权利要求 2 所述的害虫驱避粉剂,其特征在于:所述的拟除虫菊酯化合物为 2,3,5,6-四氟-4-甲氧基苄基-1R,反式-(Z)-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯。

4. 权利要求 1 所述的害虫驱避粉剂,其特征在于:所述的粉状载体选自凹凸棒土、硅藻土、膨润土、海泡石、沸石、蛭石、高岭土、滑石、叶蜡石、白炭黑、碳酸钙、煤矸石、稻壳、胡桃壳粉、锯末粉或木质素中的一种或两种以上的混合物。

5. 权利要求 1 所述的害虫驱避粉剂,其特征在于:所述粉状载体的粒径范围在 10~1000 μm 。

6. 权利要求 5 所述的害虫驱避粉剂,其特征在于:所述粉状载体的粒径范围在 60~600 μm 。

7. 权利要求 1 所述的害虫驱避粉剂的应用,其特征在于:所述的应用是将所述的害虫驱避粉剂以 $5\text{g}/\text{m}^2 \sim 40\text{g}/\text{m}^2$ 的施用量施用于户外区域中驱避害虫侵扰。

8. 权利要求 7 所述的害虫驱避粉剂的应用,其特征在于:所述的害虫为侵扰性爬虫或侵扰性飞虫。

9. 权利要求 8 所述的害虫驱避粉剂的应用,其特征在于:所述的侵扰性爬虫包括蛐蜒、马陆、蜈蚣、蚁或鼠妇。

10. 权利要求 8 所述的害虫驱避粉剂的应用,其特征在于:所述的侵扰性飞虫包括家蝇、粪蝇、果蝇、库蚊、伊蚊、按蚊、摇蚊、蚋、蠓、毛蠓或虻。

一种害虫驱避粉剂及其应用

[0001] 本申请是申请日为2010年10月18日、申请号为201010510326.0、发明名称为“一种害虫趋避粉剂及其应用”的专利申请的分案申请。

技术领域

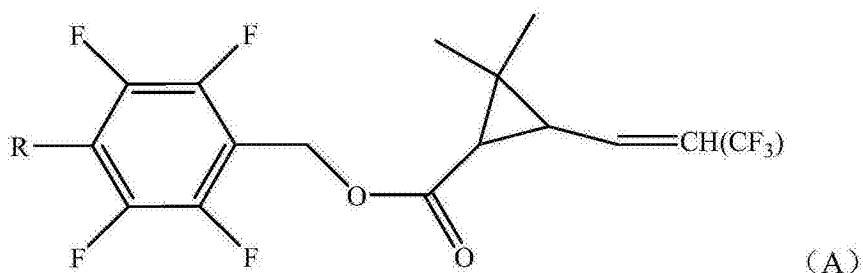
[0002] 本发明涉及一种害虫驱避剂,具体涉及一种含有拟除虫菊酯化合物的害虫驱避粉剂及其应用。

背景技术

[0003] 以往有驱避效果的粉剂,均为撒施在一定范围内,用于驱避爬虫侵入,但这类粉剂由于采用的有效成分蒸汽压较低,不足以挥发至空中对飞行害虫进行驱避,导致在撒施粉剂的范围内仍会受到飞行害虫的侵扰。现已经公开的专利 CN101478880A 中提出了一种杀虫剂组合物,其中有效成分采用了甲氧苄氟菊酯 (metofluthrin),可防止飞虫侵扰,但是在实际使用过程中我们仍觉得其药效不够理想。

[0004] 因此要达到既能驱避爬虫,又能驱避飞虫的效果,必须具有极好的蒸汽压和对害虫的高活性。我们经过研究发现,结构为式 (A) 的某些拟除虫菊酯化合物有着很高的蒸汽压。

[0005]



[0006] 其中,按蒸汽压从高到低排列,2,3,5,6-四氟-4-甲氧基苄基-3-(3,3,3-三氟-1-丙烯基)-2,2-二甲基环丙烷羧酸酯 (2176.6Pa) > 2,3,5,6-四氟-4-甲氧甲基苄基-3-(3,3,3-三氟-1-丙烯基)-2,2-二甲基环丙烷羧酸酯 (1713.8Pa) > 甲氧苄氟菊酯 (1323.8Pa)。这里的蒸汽压是用 Donovan 法 (由 Stephen F. Donovan 发表在 Journal of Chromatography A, 749(1996)123-129 的 “New method for estimating vapor pressure by the use of gas chromatography (用气相色谱估计蒸汽压的新方法)” 一文中报道的方法) 求出的在 200℃ 下的蒸汽压。同时,式 (A) 的化合物也有着较高的杀虫活性,因此,本发明的发明者尝试开发了含式 (A) 化合物的害虫驱避剂,发现其在常温挥发剂的帮助下能挥发出一定量的有效成分,同时达到驱避飞虫和爬虫的效果。

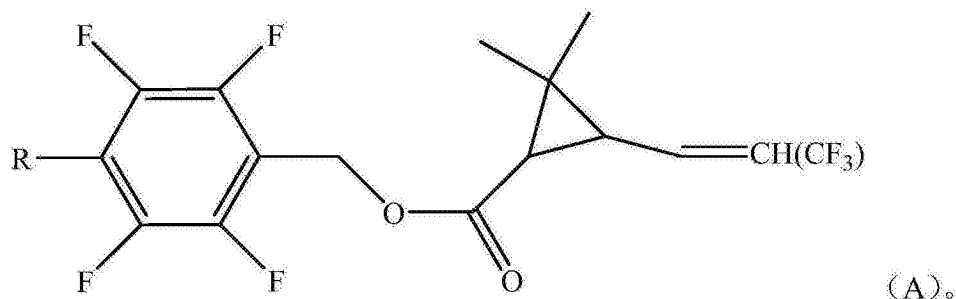
发明内容

[0007] 本发明的目的在于:提供一种害虫驱避粉剂,使其在有效驱避爬行害虫的同时也能够有效驱避飞行害虫,而且作用效果持久。

[0008] 本发明的上述目的是通过以下技术方案实现的：

[0009] 提供一种害虫驱避粉剂，它由占害虫驱避粉剂总重量 0.01%~5% 的驱虫有效成分和余量的粉状载体组成，所述驱虫有效成分为下式所示的拟除虫菊酯化合物 A，其中 R 为氢原子、甲基或甲氧基甲基；所述的粉状载体是农药学上可接受的能载荷或稀释农药的惰性成分，

[0010]



[0011] 所述的拟除虫菊酯化合物 (A) 包含满足上式的所有化合物，以及它们所有的因环丙烷平面不对称及烯烃双键不对称所引起的立体异构体或它们的混合物。具体可以选择以下各化合物：

[0012] 化合物 1：2,3,5,6-四氟苄基-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯；

[0013] 化合物 2：2,3,5,6-四氟-4-甲基苄基-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯；

[0014] 化合物 3：2,3,5,6-四氟-4-甲氧基甲基苄基-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯；

[0015] 化合物 4：2,3,5,6-四氟苄基-1R, 反式-(Z)-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯；

[0016] 化合物 5：2,3,5,6-四氟-4-甲基苄基-1R, 反式-(Z)-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯；

[0017] 化合物 6：2,3,5,6-四氟-4-甲氧基甲基苄基-1R, 反式-(Z)-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯；

[0018] 化合物 7：2,3,5,6-四氟苄基-1R-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯；

[0019] 化合物 8：2,3,5,6-四氟-4-甲基苄基-顺式-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯；

[0020] 化合物 9：2,3,5,6-四氟-4-甲氧基甲基苄基-1R, 顺式-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯；

[0021] 化合物 10：2,3,5,6-四氟-4-甲氧基甲基苄基-1R, 反式-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯；

[0022] 化合物 11：2,3,5,6-四氟-4-甲氧基甲基苄基-1R, (顺/反=2/8)-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯；

[0023] 化合物 12：2,3,5,6-四氟-4-甲氧基甲基苄基-1R, 反式-(Z/E=9/1)-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯；或者

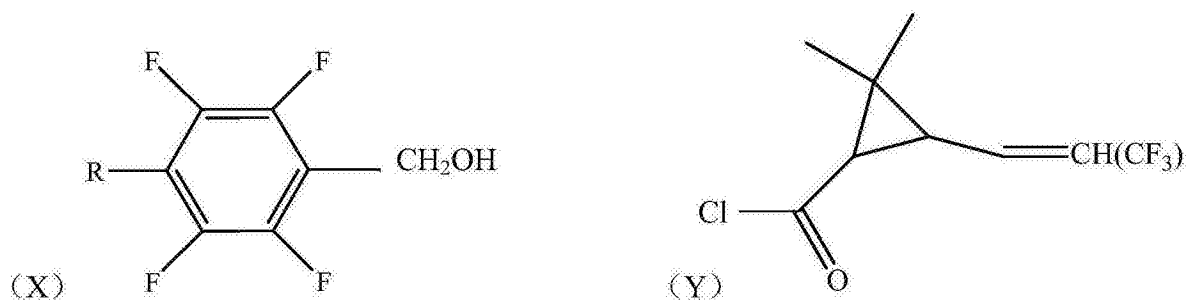
[0024] 化合物 13 :2, 3, 5, 6- 四氟 -4- 甲氧基甲基苄基 -1R, 反式 -(Z/E = 7/3)-2, 2- 二甲基 -3-(3, 3, 3- 三氟 - 丙烯基) 环丙烷羧酸酯。

[0025] 优选的化合物 (A) 中 R 为甲氧基甲基, 即优选化合物 3。

[0026] 进一步优选化合物 3 的 1R、反式、Z 构型的单一立体异构体, 即优选化合物 6。

[0027] 所述的化合物 (A) 是现有的化合物, 可以通过现有技术的多种方法制备得到, 例如: 用以下结构式为 (X) 的四氟苄醇 (其中, R 取氢、甲基或甲氧基) 和结构式为 (Y) 的菊酸酰氯进行酯化, 即可制备所述的化合物 (A)。

[0028]



[0029] 所述的酯化反应可以在甲苯、二甲苯或环己烷等有机溶剂中进行, 并加入吡啶作为缚酸剂; 所述菊酸酰氯与四氟苄醇的摩尔比为 0.8 ~ 1.5:1。

[0030] 本发明的害虫驱避粉剂中, 粉状载体是指载荷或稀释农药的惰性成分, 可以选自凹凸棒土、硅藻土、膨润土、海泡石、沸石、蛭石、高岭土、滑石、叶蜡石、白炭黑、碳酸钙、煤矸石、稻壳、胡桃壳粉、锯末粉或木质素中的一种或两种以上的混合物。

[0031] 所述粉状载体最佳粒径范围在 10 ~ 1000 μm , 优选 60 ~ 600 μm 。

[0032] 本发明的害虫驱避粉剂可以采用制备农药粉剂的常规方法制备得到, 即采用将液体原油喷加到载体的方式将有效成分与粉状载体混合; 所述的液体原油可以是化合物 (A) 溶解在醇类 (如甲醇、乙醇、异丙醇、甘油或聚乙二醇)、酮类 (如丙酮、甲基乙基酮或环己酮)、醚类 (如四氢呋喃)、脂肪族烃 (如己烷、煤油、石油醚)、酯类 (如乙酸乙酯)、腈类 (如乙腈) 等这样的有机溶剂中, 形成重量百分比为 1 ~ 50% 的溶液。

[0033] 施用本发明的害虫驱避粉剂后, 每平方米范围每小时自然挥发 0.0625mg ~ 250mg 式 (A) 化合物, 在常温下这个剂量一般足以驱避害虫。

[0034] 本发明还提供所述害虫驱避粉剂的应用方法, 即将所述的害虫驱避粉剂以 5g/ m^2 ~ 40g/ m^2 的施用量施用于户外区域中驱避害虫侵扰。

[0035] 所述的害虫包含侵扰性爬虫, 这里特别提到的有蛞蝓 (*Scutigera coleoptrata*)、马陆 (*Spirobolus Bungii*)、蜈蚣 (*Scolopendra subspinipes*)、蚁 (*Formicidae*)、鼠妇 (*Porcellio scaber Latreille*) 等; 还包含侵扰性飞虫, 有家蝇 (*Musca domestica*)、粪蝇 (*Muscina stabulans*)、果蝇 (*Drosophilidae*)、库蚊 (*Culex*)、伊蚊 (*Aedes*)、按蚊 (*Anopheles*)、摇蚊 (*Chironomidae*)、蚋 (*Simuliidae*)、蠓 (*Chironmidae*)、毛蠓 (*Psychodidae*)、虻 (*Tabanidae tabanus*) 等。

[0036] 与现有技术相比, 本发明的害虫驱避粉剂具有以下有益效果在于: 不仅能够有效驱避爬行害虫, 而且能够有效驱避飞行害虫, 且药效更加持久。

附图说明

[0037] 图 1 是试验实施例 1 和 2 的试验示意图。

[0038] 图 2 是试验实施例 3 和 4 的试验示意图。

具体实施方式

[0039] 下面用实施例的形式详细解释本发明的技术方案和效果,但本发明并不限于以下实施例。

[0040] 制剂实施例 1 ~ 18

[0041] 以 2,3,5,6-四氟-4-甲氧甲基苄基-1R, 反式-(Z)-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯(化合物 6)作为害虫驱避粉剂中的有效成分,按照表 1 中各制剂实施例的配方,采用液体原油喷加方法,与粉状载体混合,得到害虫驱避粉剂实施例 1 ~ 18。

[0042] 表 1

[0043]

制剂实施例编号	化合物 (6) 量 (g)	粉状载体	
		类型	量 (g)
1	0.01	高岭土	99.99
2	0.05	高岭土	99.95
3	0.25	高岭土	99.75
4	1.00	高岭土	99.00
5	2.50	高岭土	97.50
6	5.00	高岭土	95.00
7	0.01	硅藻土	99.99
8	0.05	硅藻土	99.95
9	0.25	硅藻土	99.75
10	1.00	硅藻土	99.00
11	2.50	硅藻土	97.50
12	5.00	硅藻土	95.00
13	0.01	煤矸石	99.99
14	0.05	煤矸石	99.95
15	0.25	煤矸石	99.75
16	1.00	煤矸石	99.00
17	2.50	煤矸石	97.50
18	5.00	煤矸石	95.00

[0044] 制剂实施例 19 ~ 32

[0045] 以 2,3,5,6-四氟-4-甲氧甲基苄基-1R, 反式-(Z)-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯(化合物 6)作为害虫驱避粉剂中的有效成分,按照表 2 中各制

剂的配方,采用液体原油喷加方法,与粉状载体混合,得到害虫驱避粉剂实施例 19 ~ 32。

[0046] 表 2

[0047]

制剂实施例编号	化合物 (6) 量 (g)	粉状载体			
		类型	量 (g)	类型	量 (g)
19	0.01	高岭土	89.99	木质素	10
20	0.10	高岭土	89.90	木质素	10
21	1.00	高岭土	89.00	木质素	10
22	0.05	高岭土	49.95	木质素	50
23	0.50	高岭土	49.50	木质素	50
24	2.00	高岭土	48.00	木质素	50
25	5.00	高岭土	45.00	木质素	50
26	0.01	碳酸钙	89.99	木质素	10
27	0.10	碳酸钙	89.90	木质素	10
28	1.00	碳酸钙	89.00	木质素	10
29	0.05	碳酸钙	49.95	木质素	50
30	0.50	碳酸钙	49.50	木质素	50
31	2.00	碳酸钙	48.00	木质素	50
32	5.00	碳酸钙	45.00	木质素	50

[0048] 制剂实施例 33

[0049] 以 1.0g 2,3,5,6-四氟苄基-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯(化合物 1),溶于 3.0g 丙酮,将该溶液均匀喷加到 99.0g 高岭土载体,充分混合后自然风干 24 小时,得到害虫驱避粉剂 33。

[0050] 制剂实施例 34

[0051] 以 0.5g 2,3,5,6-四氟-4-甲氧基苄基-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯(化合物 2),溶于 3.0g 丙酮,将该溶液均匀喷加到 99.5g 高岭土载体,充分混合后自然风干 24 小时,得到害虫驱避粉剂 34。

[0052] 制剂实施例 35

[0053] 以 0.3g 2,3,5,6-四氟-4-甲氧基苄基-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯(化合物 3),溶于 2.0g 乙醇,将该溶液均匀喷加到 99.7g 高岭土载体,充分混合后自然风干 24 小时,得到害虫驱避粉剂 35。

[0054] 制剂实施例 36

[0055] 以 3.0g 2,3,5,6-四氟-4-甲氧基苄基-1R, 反式-2,2-二甲基-3-(3,3,3-三氟-丙烯基)环丙烷羧酸酯(化合物 10),溶于 8.0g 乙腈,将该溶液均匀喷加到 97.0g 高岭土载体,充分混合后自然风干 36 小时,得到害虫驱避粉剂 36。

[0056] 制剂实施例 37

[0057] 以 4.5g 2,3,5,6-四氟-4-甲氧基苄基-1R, 反式-(Z/E = 7/3)-2,2-二甲

基-3-(3,3,3-三氟-丙基)环丙烷羧酸酯(化合物13),溶于10.0g乙酸乙酯,将该溶液均匀喷加到95.5g高岭土载体,充分混合后自然风干36小时,得到害虫驱避粉剂37。

[0058] 比较实施例1

[0059] 用百树菊酯作为害虫驱避粉剂中的有效成分,就像制剂实施例2那样生成对比常温挥发制剂1。

[0060] 比较实施例2

[0061] 用百树菊酯作为害虫驱避粉剂中的有效成分,就像制剂实施例22那样生成对比常温挥发制剂2。

[0062] 比较实施例3

[0063] 用甲氧苄氟菊酯作为害虫驱避粉剂中的有效成分,就像制剂实施例2那样生成对比常温挥发制剂3。

[0064] 比较实施例4

[0065] 用甲氧苄氟菊酯作为害虫驱避粉剂中的有效成分,就像制剂实施例1那样生成对比常温挥发制剂4。

[0066] 试验实施例1

[0067] 在无植被覆盖的平地上,撒施5g制剂实施例2的害虫驱避粉剂,圈出一个2m×2m大小的正方形,如图1所示。人站在中央分别观察1小时、4小时、8小时开始30分钟之间进入圈内的蚂蚁次数和圈内人被蚊虫叮咬的次数。

[0068] 进而,采用制剂实施例22,比较实施例1、比较实施例2和比较实施例3将上述试验各重复一次,空白对照仅为粉状载体高岭土,结果记录在表3中。

[0069] 从结果可以看出,相比空白对照,制剂实施例2和制剂实施例22在0~8小时内起到驱避爬虫和飞虫作用,而比较实施例1和比较实施例2仅能起到驱避爬虫而不能驱避飞虫。比较实施例3在0~4小时内有驱避爬虫和飞虫作用,但在4~8小时内驱避飞虫的效果下降。

[0070] 表3

[0071]

制剂编号	各时间段观察情况					
	1小时 进入蚂蚁	1小时蚊虫 叮咬次数	4小时 进入蚂蚁	4小时蚊虫 叮咬次数	8小时 进入蚂蚁	8小时蚊虫 叮咬次数
制剂实施例2	0	0	0	0	0	1
制剂实施例22	0	0	0	0	0	0
比较实施例1	0	5	0	1	0	4
比较实施例2	0	2	0	3	0	3
比较实施例3	0	0	0	1	0	3
空白对照	5	3	9	2	6	5

[0072] 试验实施例2

[0073] 选择制剂实施例1、3~21或23~37中的任一实施例的驱虫粉剂,按试验实施例1所述的方法进行试验,结果都是可以在0~8小时内起到驱避爬虫和飞虫作用。

[0074] 试验实施例 3

[0075] 在人四周的 1 平方米内均匀撒施 25g 制剂实施例 1, 如图 2 所示。人站在中央分别观察 1 小时、4 小时、8 小时开始 30 分钟之内被蚊虫叮咬的次数。

[0076] 进而, 采用制剂实施例 26 和比较实施例 4 将上述试验各重复一次, 空白对照仅为粉体, 结果在表 4 中。

[0077] 从结果可以看出, 相比空白对照, 制剂实施例 1 和制剂实施例 26 在 0 ~ 8 小时内起到驱避飞虫作用, 而比较实施例 4 在 0 ~ 4 小时内有驱避飞虫作用, 但在 4 ~ 8 小时内驱避飞虫的效果下降。

[0078] 表 4

[0079]

制剂编号	各时间段观察情况		
	1 小时叮咬次数	4 小时叮咬次数	8 小时叮咬次数
制剂实施例 1	0	0	0
制剂实施例 26	0	0	0
比较实施例 4	0	1	1
空白对照	2	1	3

[0080] 试验实施例 4

[0081] 实施例 2 ~ 25、27 ~ 37 中任何一实施例, 按试验实施例 3 所述方法都可以在 0 ~ 8 小时内起到驱避蚊虫作用。

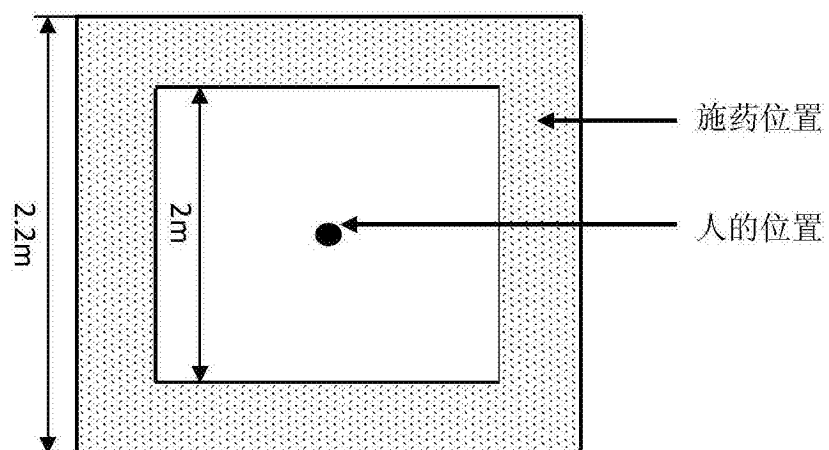


图 1

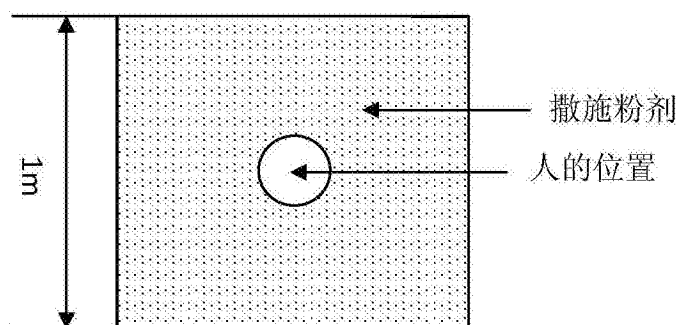


图 2