



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 102822149 B

(45) 授权公告日 2014. 12. 31

(21) 申请号 201180016745. 1

(22) 申请日 2011. 03. 18

(30) 优先权数据

2010-081657 2010. 03. 31 JP

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2012. 09. 28

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/JP2011/057492 2011. 03. 18

(87) PCT国际申请的公布数据

W02011/122505 EN 2011. 10. 06

(73) 专利权人 住友化学株式会社

地址 日本国东京都

(72) 发明人 松尾宪忠

(74) 专利代理机构 中科专利商标代理有限责任

公司 11021

代理人 李新红

(51) Int. Cl.

C07D 249/12(2006. 01)

A01N 53/04(2006. 01)

(56) 对比文件

US 4176189 A, 1979. 11. 27, 全文.

CN 101088995 A, 2007. 12. 19, 全文.

EP 0729949 A2, 1996. 09. 04, 说明书第 1 页  
第 1 行 - 第 2 页第 30 行, 第 8 页第 55-60 行, 第 4  
页表格 - 第 6 页第 16 行, 第 12 页表 4-5, 权利要  
求 9.

审查员 王茜

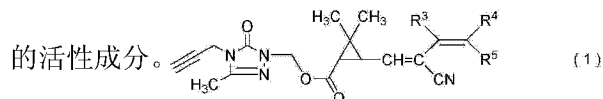
权利要求书1页 说明书28页

(54) 发明名称

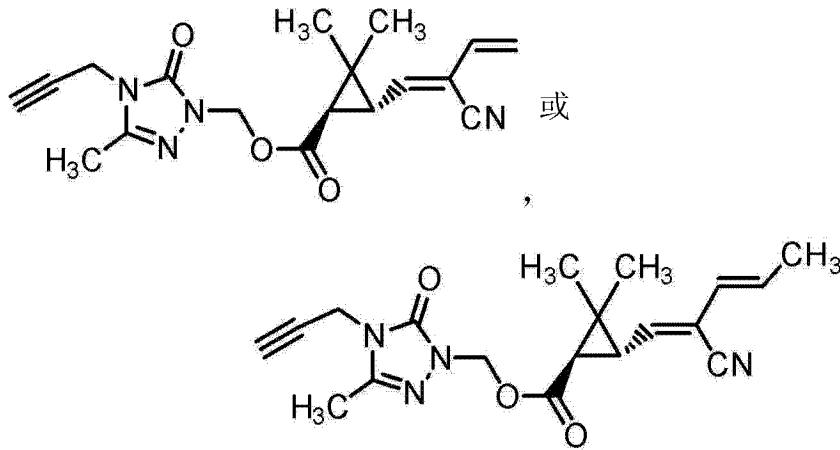
酯化合物及其应用

(57) 摘要

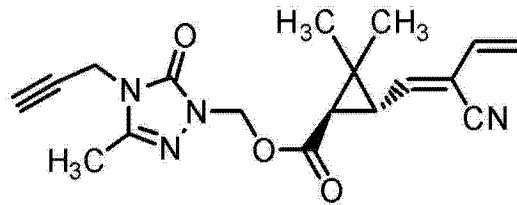
本发明公开了一种由式 (1) 表示的酯化合物, 其中 R<sup>3</sup>表示氢或甲基, R<sup>4</sup>表示氢或 C1-C4 烷基, 并且 R<sup>5</sup>表示氢或 C1-C4 烷基, 所述酯化合物具有出色的害虫防治效果, 因此可用作害虫防治剂的活性成分。



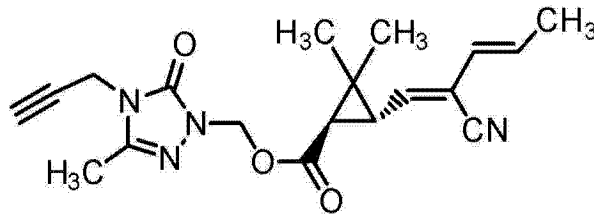
1. 一种由下式表示的酯化合物：



2. 根据权利要求 1 所述的酯化合物，其中所述酯化合物由下式表示：



3. 根据权利要求 1 所述的酯化合物，其中所述酯化合物由下式表示：



4. 一种害虫防治剂，所述害虫防治剂包含根据权利要求 1 所述的酯化合物和惰性载体。

5. 一种防治害虫的方法，所述方法包括：将有效量的根据权利要求 1 所述的酯化合物施加至害虫或害虫栖息场所的步骤。

6. 一种防治害虫的方法，所述方法包括：将有效量的根据权利要求 1 所述的酯化合物施加至蟑螂或蟑螂栖息场所的步骤。

7. 根据权利要求 6 所述的防治害虫的方法，其中所述蟑螂是美洲大蠊。

8. 根据权利要求 6 所述的防治害虫的方法，其中所述蟑螂是德国小蠊。

9. 一种防治害虫的方法，所述方法包括：将有效量的根据权利要求 1 所述的酯化合物喷雾至蟑螂或蟑螂栖息场所的步骤。

10. 根据权利要求 9 所述的防治害虫的方法，其中所述蟑螂是美洲大蠊。

11. 根据权利要求 9 所述的防治害虫的方法，其中所述蟑螂是德国小蠊。

## 酯化合物及其应用

### 技术领域

[0001] 本发明涉及酯化合物及其应用。

### 背景技术

[0002] 迄今为止,已经合成了多种化合物以便防治害虫。例如,JP-A-57-158765 中描述了特定的酯化合物。

### 发明内容

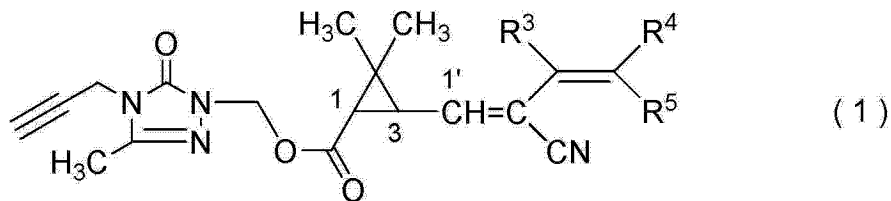
[0003] 本发明的目的是提供一种具有出色的害虫防治效果的新化合物。

[0004] 本发明的发明人进行了深入地研究并且发现由如下所示的式 (1) 表示的酯化合物具有出色的害虫防治效果,并且得到本发明。

[0005] 换言之,本发明涉及以下发明:

[0006] [1] 一种由式 (1) 表示的酯化合物:

[0007]



[0008] 其中  $R^3$  表示氢或甲基,  $R^4$  表示氢或 C1-C4 烷基,并且  $R^5$  表示氢或 C1-C4 烷基(在下文中称为本发明的化合物);

[0009] [2] 根据 [1] 所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,环丙烷环的 1-位上的取代基与环丙烷环的 3-位上的取代基的相对构型是反式构型;

[0010] [3] 根据 [1] 所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,环丙烷环的 1-位的绝对构型是 R 构型;

[0011] [4] 根据 [1] 所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,环丙烷环的 1-位的绝对构型是 R 构型,并且环丙烷环的 1-位上的取代基与环丙烷环的 3-位上的取代基的相对构型是反式构型;

[0012] [5] 根据 [1] 所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,环丙烷环的 3-位上的取代基中存在的 1'-位的取代基的相对构型是 Z-构型;

[0013] [6] 根据 [1] 所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,环丙烷环的 1-位的绝对构型是 R 构型,并且环丙烷环的 3-位上的取代基中存在的 1'-位的取代基的相对构型是 Z-构型;

[0014] [7] 根据 [1] 所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,环丙烷环的 1-位的绝对构型是 R 构型,环丙烷环的 1-位上的取代基与环丙烷环的 3-位上的取代基的相对构型是反式构型,并且环丙烷环的 3-位上的取代基中存在的 1'-位的取代基的相对构型是 Z-构型;

[0015] [8] 根据 [1] 至 [7] 中的任一项所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,  $R^3$  是氢;

[0016] [9] 根据 [1] 至 [7] 中的任一项所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,  $R^4$  是氢或甲基;

- [0017] [10] 根据 [1] 至 [7] 中的任一项所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,  $R^4$  是氢;
- [0018] [11] 根据 [1] 至 [7] 中的任一项所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,  $R^4$  是甲基;
- [0019] [12] 根据 [1] 至 [7] 中的任一项所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,  $R^5$  是氢;
- [0020] [13] 根据 [1] 至 [7] 中的任一项所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,  $R^3$  是氢,并且  $R^4$  是氢或甲基;
- [0021] [14] 根据 [1] 至 [7] 中的任一项所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,  $R^3$  是氢,并且  $R^4$  是氢;
- [0022] [15] 根据 [1] 至 [7] 中的任一项所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,  $R^3$  是氢,并且  $R^4$  是甲基;
- [0023] [16] 根据 [1] 至 [7] 中的任一项所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,  $R^3$  是氢,并且  $R^5$  是氢;
- [0024] [17] 根据 [1] 至 [7] 中的任一项所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,  $R^4$  是氢或甲基,并且  $R^5$  是氢;
- [0025] [18] 根据 [1] 至 [7] 中的任一项所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,  $R^4$  是氢,并且  $R^5$  是氢;
- [0026] [19] 根据 [1] 至 [7] 中的任一项所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,  $R^4$  是甲基,并且  $R^5$  是氢;
- [0027] [20] 根据 [1] 至 [7] 中的任一项所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢或甲基,并且  $R^5$  是氢;
- [0028] [21] 根据 [1] 至 [7] 中的任一项所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢,并且  $R^5$  是氢;
- [0029] [22] 根据 [1] 至 [7] 中的任一项所述的酯化合物,其中在式 (1) 中,  $R^3$  是氢,  $R^4$  是甲基,并且  $R^5$  是氢;
- [0030] [23] 一种害虫防治剂,所述害虫防治剂包含根据 [1] 至 [22] 中的任一项所述的酯化合物和惰性载体;
- [0031] [24] 一种防治害虫的方法,所述方法包括:将有效量的根据 [1] 至 [22] 中的任一项所述的酯化合物施加至害虫或害虫栖息场所的步骤;
- [0032] [25] 一种防治害虫的方法,所述方法包括:将有效量的根据 [1] 至 [22] 中的任一项所述的酯化合物施加至蟑螂或蟑螂栖息场所的步骤;
- [0033] [26] 根据 [25] 所述的防治害虫的方法,其中所述蟑螂是美洲大蠊 (*Periplaneta Americana*);
- [0034] [27] 根据 [25] 所述的防治害虫的方法,其中所述蟑螂是德国小蠊 (*Blattella germanica*);
- [0035] [28] 一种防治害虫的方法,所述方法包括:将有效量的根据 [1] 至 [22] 中的任一项所述的酯化合物喷雾至蟑螂或蟑螂栖息场所的步骤;
- [0036] [29] 根据 [28] 所述的防治害虫的方法,其中所述蟑螂是美洲大蠊 (*Periplaneta Americana*);
- [0037] [30] 根据 [28] 所述的防治害虫的方法,其中所述蟑螂是德国小蠊 (*Blattella germanica*)。



- [0056] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是氢或甲基。
- [0057] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且  $R^4$  是氢或甲基。
- [0058] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且  $R^4$  是氢或甲基。
- [0059] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且  $R^4$  是氢或甲基。
- [0060] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是氢或甲基, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。
- [0061] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是氢或甲基, 并且环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。
- [0062] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是氢或甲基, 环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。
- [0063] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是氢。
- [0064] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且  $R^4$  是氢。
- [0065] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且  $R^4$  是氢。
- [0066] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且  $R^4$  是氢。
- [0067] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是氢, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。
- [0068] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是氢, 并且环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。
- [0069] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是氢, 环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。
- [0070] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是甲基。
- [0071] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且  $R^4$  是甲基。
- [0072] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且  $R^4$  是甲基。
- [0073] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且  $R^4$  是甲基。
- [0074] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是甲基, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0075] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是甲基, 并且环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0076] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是甲基, 环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0077] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^5$  是氢。

[0078] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且  $R^5$  是氢。

[0079] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且  $R^5$  是氢。

[0080] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且  $R^5$  是氢。

[0081] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^5$  是氢, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0082] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^5$  是氢, 并且环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0083] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^5$  是氢, 环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0084] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢, 并且  $R^4$  是氢或甲基。

[0085] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^3$  是氢, 并且  $R^4$  是氢或甲基。

[0086] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且  $R^3$  是氢, 并且  $R^4$  是氢或甲基。

[0087] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^3$  是氢, 并且  $R^4$  是氢或甲基。

[0088] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢, 并且  $R^4$  是氢或甲基, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0089] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢或甲基, 并且环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0090] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢或甲基, 环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0091] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢, 并且  $R^4$  是氢。

[0092] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^3$  是氢, 并且  $R^4$  是氢。

[0093] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且  $R^3$  是氢, 并且  $R^4$  是氢。

[0094] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^3$  是氢, 并且  $R^4$  是氢。

[0095] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0096] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢, 并且环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0097] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢, 环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0098] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢, 并且  $R^4$  是甲基。

[0099] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^3$  是氢, 并且  $R^4$  是甲基。

[0100] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型,  $R^3$  是氢, 并且  $R^4$  是甲基。

[0101] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^3$  是氢, 并且  $R^4$  是甲基。

[0102] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是甲基, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0103] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是甲基, 并且环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0104] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是甲基, 环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0105] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢, 并且  $R^5$  是氢。

[0106] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^3$  是氢, 并且  $R^5$  是氢。

[0107] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型,  $R^3$  是氢, 并且  $R^5$  是氢。

[0108] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^3$  是氢, 并且  $R^5$  是氢。

[0109] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^5$  是氢, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。



[0110] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^5$  是氢, 并且环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0111] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^5$  是氢, 环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0112] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是氢或甲基, 并且  $R^5$  是氢。

[0113] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^4$  是氢或甲基, 并且  $R^5$  是氢。

[0114] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型,  $R^4$  是氢或甲基, 并且  $R^5$  是氢。

[0115] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^4$  是氢或甲基, 并且  $R^5$  是氢。

[0116] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是氢或甲基,  $R^5$  是氢, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0117] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是氢或甲基,  $R^5$  是氢, 并且环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0118] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是氢或甲基,  $R^5$  是氢, 环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0119] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是氢, 并且  $R^5$  是氢。

[0120] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^4$  是氢, 并且  $R^5$  是氢。

[0121] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型,  $R^4$  是氢, 并且  $R^5$  是氢。

[0122] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^4$  是氢, 并且  $R^5$  是氢。

[0123] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是氢,  $R^5$  是氢, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0124] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是氢,  $R^5$  是氢, 并且环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0125] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是氢,  $R^5$  是氢, 环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

- [0126] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是甲基, 并且  $R^5$  是氢。
- [0127] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^4$  是甲基, 并且  $R^5$  是氢。
- [0128] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型,  $R^4$  是甲基, 并且  $R^5$  是氢。
- [0129] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^4$  是甲基, 并且  $R^5$  是氢。
- [0130] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是甲基,  $R^5$  是氢, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。
- [0131] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是甲基,  $R^5$  是氢, 并且环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。
- [0132] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^4$  是甲基,  $R^5$  是氢, 环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。
- [0133] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢或甲基, 并且  $R^5$  是氢。
- [0134] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢或甲基, 并且  $R^5$  是氢。
- [0135] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型,  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢或甲基, 并且  $R^5$  是氢。
- [0136] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢或甲基, 并且  $R^5$  是氢。
- [0137] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢或甲基,  $R^5$  是氢, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。
- [0138] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢或甲基,  $R^5$  是氢, 并且环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。
- [0139] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢或甲基,  $R^5$  是氢, 环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1'- 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。
- [0140] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢, 并且  $R^5$  是氢。
- [0141] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢, 并且  $R^5$  是氢。
- [0142] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型,  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢, 并且  $R^5$  是氢。
- [0143] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环

的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢, 并且  $R^5$  是氢。

[0144] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢,  $R^5$  是氢, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0145] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢,  $R^5$  是氢, 并且环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0146] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是氢,  $R^5$  是氢, 环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0147] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是甲基, 并且  $R^5$  是氢。

[0148] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^3$  是氢,  $R^4$  是甲基, 并且  $R^5$  是氢。

[0149] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型,  $R^3$  是氢,  $R^4$  是甲基, 并且  $R^5$  是氢。

[0150] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型,  $R^3$  是氢,  $R^4$  是甲基, 并且  $R^5$  是氢。

[0151] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是甲基,  $R^5$  是氢, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0152] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是甲基,  $R^5$  是氢, 并且环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

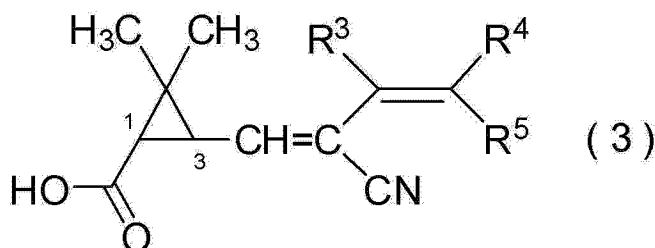
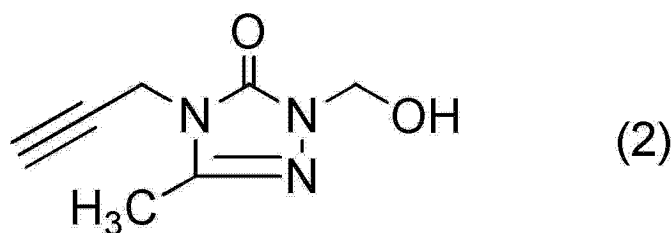
[0153] 由式 (1) 表示的酯化合物, 其中  $R^3$  是氢,  $R^4$  是甲基,  $R^5$  是氢, 环丙烷环的 1- 位的绝对构型是 R 构型, 环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是反式构型, 并且环丙烷环的 3- 位上的取代基中存在的 1' - 位的取代基的相对构型是 Z- 构型。

[0154] 下面将描述用于制备本发明的化合物的方法。

[0155] 本发明的化合物可以例如通过下面描述的制备方法制备。

[0156] 一种使由式 (2) 表示的醇化合物与由式 (3) 表示的羧酸化合物或其反应性衍生物反应的方法:

[0157]



[0158] (其中  $R^3$ 、 $R^4$  和  $R^5$  具有与上面的描述相同的含义)。

[0159] 反应性衍生物的实例包括由式 (3) 表示的羧酸化合物的酰卤, 羧酸化合物的酸酐, 以及羧酸化合物的甲酯和乙酯等。酰卤的实例包括酰氯化合物。

[0160] 该反应通常在溶剂中在缩合剂或碱的存在下进行。

[0161] 缩合剂的实例包括二环己基碳二亚胺和 1-乙基-3-(3-二甲基氨基丙基)碳二亚胺盐酸盐。

[0162] 碱的实例包括有机碱, 如三乙胺、吡啶、N,N-二乙苯胺、4-二甲基氨基吡啶和二异丙基乙胺。

[0163] 溶剂的实例包括烃, 如苯、甲苯和己烷; 醚, 如二乙基醚和四氢呋喃; 卤代烃, 如氯仿、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷和氯苯; 以及它们的混合溶剂。

[0164] 反应时间通常在 5 分钟至 72 小时的范围内。

[0165] 反应温度通常在  $-20^{\circ}\text{C}$  至  $100^{\circ}\text{C}$  的范围内 (在所使用的溶剂的沸点低于  $100^{\circ}\text{C}$  的情况下,  $-20^{\circ}\text{C}$  至溶剂的沸点), 并且优选  $-5^{\circ}\text{C}$  至  $100^{\circ}\text{C}$  (在所使用的溶剂的沸点低于  $100^{\circ}\text{C}$  的情况下,  $-5^{\circ}\text{C}$  至溶剂的沸点)。

[0166] 在反应中, 由式 (2) 表示的醇化合物与由式 (3) 表示的羧酸化合物或其反应性衍生物的使用摩尔比可以任选地设定, 但是优选为等摩尔比或接近等摩尔比。

[0167] 基于 1mol 的由式 (2) 表示的醇化合物, 缩合剂或碱通常可以在 0.25mol 至过量的范围内的任意量使用, 并且优选 0.5mol 至 2mol。这些缩合剂或碱根据由式 (3) 表示的羧酸化合物或其反应性衍生物的种类适当地选择。

[0168] 在反应完成之后, 通常对反应混合物进行后处理操作: 过滤反应混合物并浓缩滤液, 或者将水倒入至反应混合物中, 之后用有机溶剂萃取并且进一步浓缩, 从而可以获得本发明的化合物。可以将所获得的本发明的化合物通过如层析和蒸馏之类的操作提纯。

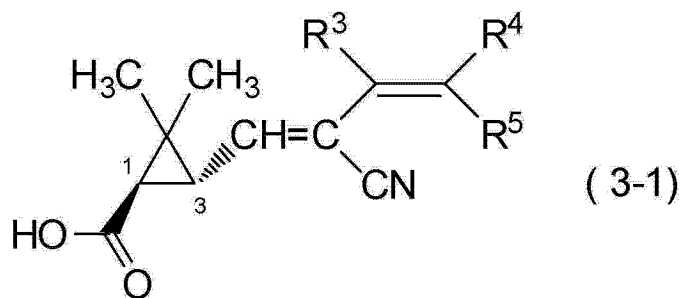
[0169] 由式 (2) 表示的醇化合物是 JP-A-58-158765 中描述的化合物。

[0170] 本发明的中间体可以通过例如如下所示的方法制备。

[0171] 在由式 (3) 表示的羧酸化合物中, 可以例如通过以下方法制备其中环丙烷环的 1-位上的取代基与环丙烷环的 3-位上的取代基的相对构型是反式构型的由式 (3-1) 表示的羧酸化合物。

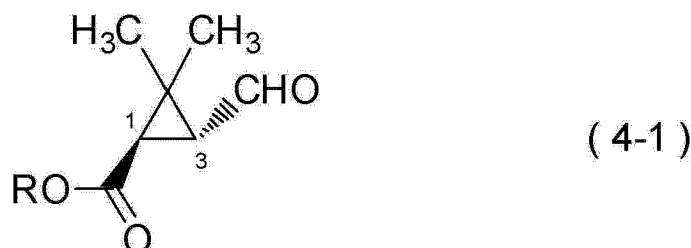
[0172] 换言之, 由式 (3-1) 表示的羧酸化合物:

[0173]



[0174] (其中  $R^3$ 、 $R^4$  和  $R^5$  具有与上面的描述相同的含义), 可以通过以下方法制备: 使由式 (4-1) 表示的萆醛酯 (caronaldehyde ester) 衍生物:

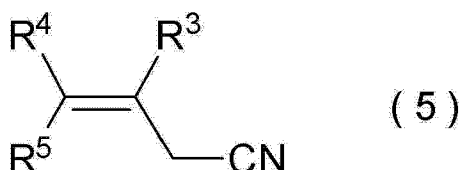
[0175]



[0176] (其中 R 表示 C1-C4 烷基),

[0177] 与由式 (5) 表示的腈化合物:

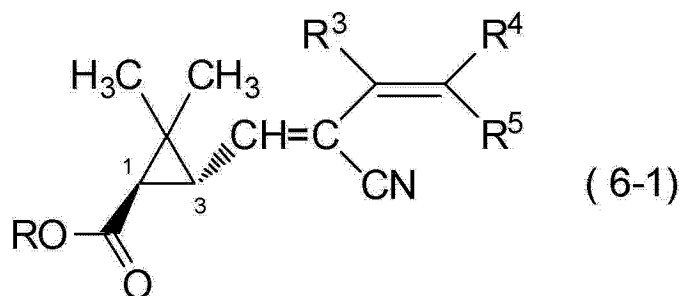
[0178]



[0179] (其中  $R^3$ 、 $R^4$  和  $R^5$  具有与上面的描述相同的含义)

[0180] 在碱的存在下反应, 以获得由式 (6-1) 表示的化合物:

[0181]



[0182] (其中  $R$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  和  $R^5$  具有与以上的限定相同的含义), 并且将所获得的化合物在碱的存在下进一步水解。

[0183] 由式 (6-1) 表示的化合物通常可以通过以下方式制备: 在  $0^{\circ}\text{C}$  至  $80^{\circ}\text{C}$ , 并且优选  $0^{\circ}\text{C}$  至  $30^{\circ}\text{C}$  的范围内的温度, 使用基于 1mol 的由式 (4-1) 表示的萆醛酯衍生物为 1.0 至 1.5mol 的量的由式 (5) 表示的腈化合物和 1 至 10mol 的量的碱在极性溶剂中反应。碱的实例包括碳酸盐如碳酸钾和碳酸钠; 以及碱金属化合物如氢化钠。极性溶剂的实例包括酰胺如 N, N-二甲基甲酰胺; 以及亚砷如二甲亚砷。

[0184] 在反应完成之后, 对反应混合物进行加入水, 之后用有机溶剂萃取并且进一步干

燥和浓缩有机层的后处理操作,从而可以获得由式 (6-1) 表示的化合物。

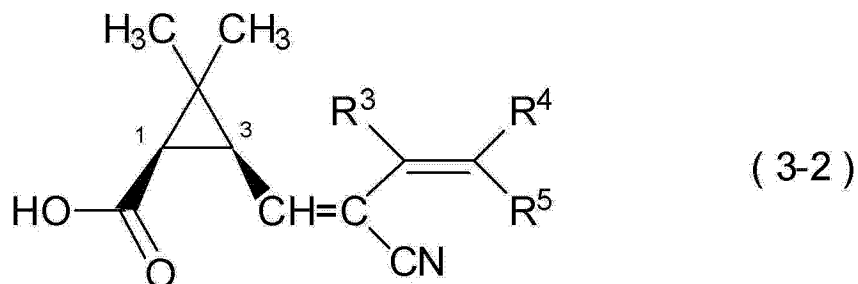
[0185] 在水解由式 (6-1) 表示的化合物的步骤中,由式 (3-1) 表示的羧酸化合物通常可以通过以下方法制备:在 0℃ 至 80℃,并且优选 0℃ 至 30℃ 的温度,使用基于 1mol 的由式 (6-1) 表示的化合物为 1 至 10mol 的量的碱在溶剂中反应。碱的实例包括碳酸碱金属盐如碳酸钾和碳酸钠;以及碱金属化合物如氢氧化钠。溶剂的实例包括醚如四氢呋喃;醇如甲醇;水;及其混合物。

[0186] 在反应完成之后,对反应溶液进行酸化,之后用有机溶剂萃取并且进一步将有机层干燥和浓缩的后处理操作,从而可以获得由式 (3-1) 表示的羧酸化合物。

[0187] 在由式 (3) 表示的羧酸化合物中,可以例如通过以下方法制备其中环丙烷环的 1- 位上的取代基与环丙烷环的 3- 位上的取代基的相对构型是顺式构型的由式 (3-2) 表示的羧酸化合物。

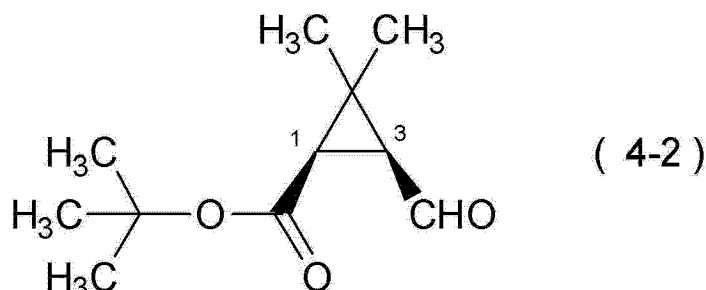
[0188] 换言之,由式 (3-2) 表示的羧酸化合物:

[0189]



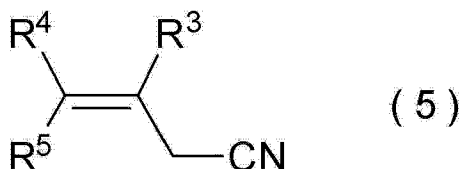
[0190] (其中 R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 具有与上面的描述相同的含义),可以通过以下方法制备:使由式 (4-2) 表示的萹醛酯衍生物:

[0191]



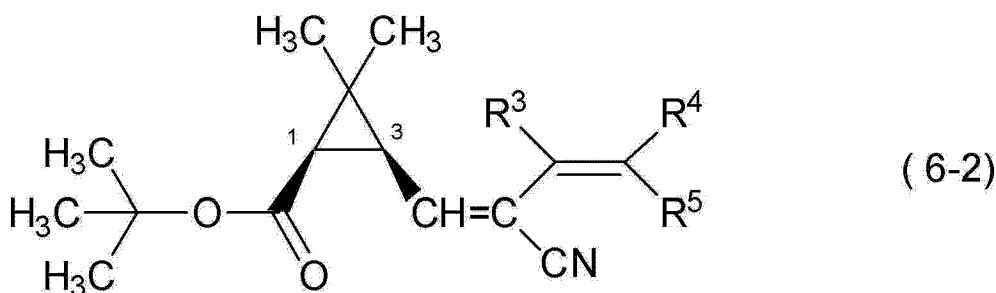
[0192] 与由式 (5) 表示的腈衍生物:

[0193]



[0194] (其中 R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 具有与上面的描述相同的含义),在碱的存在下反应,以获得由式 (6-2) 表示的化合物:

[0195]



[0196] (其中  $R^3$ 、 $R^4$  和  $R^5$  具有与上面的描述相同的含义), 并且将所获得的化合物在酸催化剂的存在下加热。

[0197] 由式 (6-2) 表示的化合物通常可以通过以下方式制备: 在  $0^{\circ}\text{C}$  至  $80^{\circ}\text{C}$ , 并且优选  $0^{\circ}\text{C}$  至  $30^{\circ}\text{C}$  的温度, 使用基于  $1\text{mol}$  的由式 (4-2) 表示的萹醛酯衍生物为  $1.0$  至  $1.5\text{mol}$  的量的由式 (5) 表示的腈化合物和  $1$  至  $10\text{mol}$  的量的碱, 在极性溶剂中反应。碱的实例包括碳酸盐如碳酸钾和碳酸钠; 以及碱金属化合物如氢化钠。极性溶剂的实例包括酰胺如  $N,N$ -二甲基甲酰胺; 以及亚砷如二甲亚砷。

[0198] 在完成反应之后, 对反应混合物进行加入水, 之后用有机溶剂萃取并且进一步干燥和浓缩有机层的后处理操作, 从而可以获得由式 (6-2) 表示的化合物。

[0199] 在从由式 (6-2) 表示的化合物制备由式 (3-2) 表示的化合物的步骤中, 在通常  $50^{\circ}\text{C}$  至  $150^{\circ}\text{C}$  的反应温度 (在溶剂的沸点低于  $150^{\circ}\text{C}$  的情况下, 则是  $50^{\circ}\text{C}$  至溶剂的沸点), 使用基于  $1\text{mol}$  的由式 (6-2) 表示的化合物为  $0.005$  至  $0.05\text{mol}$  的量的酸催化剂进行反应, 从而可以制备由式 (3-2) 表示的羧酸化合物。酸催化剂的实例包括对甲苯磺酸等。溶剂的实例包括醚如四氢呋喃; 烃如甲苯; 及其混合物。

[0200] 在完成反应之后, 由式 (3-2) 表示的羧酸化合物可以通过进行有机层的干燥和浓缩的后处理操作获得。

[0201] 由式 (4-1) 表示的萹醛酯衍生物是四面体 (Tetrahedron) 45, 3039-3052 (1989) 中描述的化合物。

[0202] 由式 (4-2) 表示的萹醛酯衍生物是美国化学会志 (Journal of American Chemical Society), 1982, 104, 4282-4283 中描述的化合物。

[0203] 由式 (5) 表示的腈化合物可以根据如在美国化学会志 (Journal of American Chemical Society), 2008, 130, 3734 中描述的已知方法合成。

[0204] 本发明的化合物对其具有防治效果的害虫的实例包括有害的节肢动物害虫, 如有害的昆虫和有害的螨虫, 并且更具体地是以下的害虫。

[0205] 半翅目 (Hemiptera): 飞虱科 (Planthoppers) 如灰飞虱 (*Laodelphax striatellus*)、褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*) 和白背稻飞虱 (*Sogatella furcifera*), 角顶叶蝉科 (leafhoppers) 如黑尾叶蝉 (*Nephotettix cincticeps*) 和二点黑尾叶蝉 (*Nephotettix virescens*), 蚜科 (aphids) 如棉蚜 (*Aphis gossypii*) 和桃蚜 (*Myzus persicae*), 盲蝽科 (plant bugs) 如花角绿蝽 (*Nezara antennata*)、豆蜂缘蝽 (*Riptortus clavatus*)、日本二星蝽 (*Eysarcoris lewisi*)、尖角二星蝽 (*Eysarcoris parvus*)、斯氏珀蝽 (*Plautia stali*) 和混茶翅蝽 (*Halyomorpha mista*), 粉虱科 (white flies) 如温室粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*)、甘薯粉虱 (*Bemisia tabaci*) 和银叶粉虱 (*Bemisia argentifolii*), 蚧科 (scales) 如红肾圆盾蚧 (*Aonidiella aurantii*)、圣琼斯康盾蚧

(*Comstockaspis perniciosus*)、柑橘尖盾蚧 (*Unaspis citri*)、红龟蜡蚧 (*Ceroplastes rubens*) 和澳洲吹绵蚧 (*Icerya purchasi*)，网蝽科 (lace bugs)，臭虫科 (bed bugs) 如温带臭虫 (*Cimex lectularius*)，木虱科 (jumping plantlice) 等；

[0206] 鳞翅目 (Lepidoptera)：螟蛾科 (Pyralidae) 如二化螟 (*Chilo suppressalis*)、稻纵卷叶野螟 (*Cnaphalocrosis medinalis*)、棉卷叶野螟 (*Notarcha derogata*) 和印度谷斑螟 (*Plodia interpunctella*)、斜纹贪夜蛾 (*Spodoptera litura*)、粘虫 (*Pseudaletia separata*)、夜蛾科 (Noctuidae) 如粉夜蛾属 (*Trichoplusia* spp.)、实夜蛾属 (*Heliothis* spp.) 和金刚钻属 (*Earias* spp.)，粉蝶科 (Pieridae) 如菜粉蝶 (*Pieris rapae*)，卷蛾科 (Tortricidae) 如褐带卷蛾属 (*Adoxophyes* spp.)、梨小食心虫 (*Grapholita molesta*)、棉褐带卷蛾 (*Adoxophyes orana fasciata*) 和苹果皮小卷蛾 (*Cydia pomonella*)，蛀果蛾科 (Carposinidae) 如桃柱果蛾 (*Carposina niponensis*)，潜蛾科 (Lyonetiidae) 如潜蛾属 (*Lyonetia* spp.)，毒蛾科 (Lymantriidae) 如毒蛾属 (*Lymantria* spp.)，毒蛾科 (Lymantriidae) 如黄毒蛾属 (*Euproctis* spp.)，巢蛾科 (Yponomeutidae) 如小菜蛾 (*Plutella xylostella*)，麦蛾科 (Gelechiidae) 如红铃麦蛾 (*Pectinophora gossypiella*)，灯蛾科 (Arctiidae) 如美国白蛾 (*Hyphantria cunea*)，谷蛾科 (Tineidae) 如衣蛾 (*Tinea translucens*) 和幕谷蛾 (*Tineola bisselliella*) 等；

[0207] 双翅目 (Diptera)：库蚊属 (*Culex* spp.) 如淡色库蚊 (*Culex pipiens pallens*)、三带喙库蚊 (*Culex tritaeniorhynchus*) 和致倦库蚊 (*Culex quinquefasciatus*)，伊蚊属 (*Aedes* spp.) 如埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*) 和白纹伊蚊 (*Aedes albopictus*)，按蚊属 (*Anopheles* spp.) 如中华按蚊 (*Anopheles sinensis*) 和刚比亚按蚊 (*Anopheles gambiae*)，摇蚊科 (Chironomidae)，蝇科 (Muscidae) 如家蝇 (家蝇 (*Musca domestica*)) 和厩腐蝇 (*Muscina stabulans*)，丽蝇科 (Calliphoridae)，麻蝇科 (Sarcophagidae)，夏厕蝇 (little housefly)，花蝇科 (Anthomyiidae) 如灰地种蝇 (*Delia platura*) 和葱地种蝇 (*Delia antiqua*)，实蝇科 (Tephritidae)，果蝇科 (Drosophilidae)，蚤蝇科 (Phoridae) 如东亚异蚤蝇 (*Megaselia spiracularis*)，毛蠓 (*Clogmia albipunctata*)，毛蠓科 (Psychodidae)，蚋科 (Simuliidae)，虻科 (Tabanidae)，螫蝇科 (Stomoxysidae)，潜蝇科 (Agromyzidae) 等；

[0208] 鞘翅目 (Coleoptera)：根萤叶甲属 (*Diabrotica* spp.) 如玉米根萤叶甲 (*Diabrotica virgifera virgifera*) 和黄瓜十一星叶甲食根亚种 (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)，金龟科 (Scarabaeidae) 如古铜异丽金龟 (*Anomala cuprea*) 和多色异丽金龟 (*Anomala rufocuprea*)，象虫科 (Curculionidae) 如玉米象 (*Sitophilus zeamais*)、稻水象 (*Lissorhoptrus oryzophilus*) 和绿豆象 (*Callosobruchus chinensis*)，拟步甲科 (Tenebrionidae) 如黄粉甲 (*Tenebrio molitor*) 和赤拟谷盗 (*Tribolium castaneum*)，叶甲科 (Chrysomelidae) 如水稻负泥虫 (*Oulema oryzae*)、黄守瓜 (*Aulacophora femoralis*)、黄曲条菜跳甲 (*Phyllotreta striolata*) 和马铃薯叶甲 (*Leptinotarsa decemlineata*)，皮蠹科 (Dermestidae) 如白腹皮蠹 (*Dermestes maculatus*)，窃蠹科 (Anobiidae)，食植瓢虫属 (*Epilachna* spp.) 如茄二十八星瓢虫 (*Epilachna vigintioctopunctata*)，粉蠹科 (粉蠹科 (Lyctidae))，长蠹科 (Bostrychidae)，蛛甲科 (Ptinidae)，天牛科 (Cerambycidae)，毒隐翅虫 (*Paederus*



fuscipes) 等;

[0209] 蜚蠊目 (Blattodea): 德国小蠊 (*Blattella germanica*)、黑胸大蠊 (*Periplaneta fuliginosa*)、美洲大蠊 (*Periplaneta americana*)、褐斑大蠊 (*Periplaneta brunnea*)、东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*) 等;

[0210] 缨翅目 (Thysanoptera): 南黄蓟马 (*Thrips palmi*)、烟蓟马 (*Thrips tabaci*)、西花蓟马 (*Frankliniella occidentalis*)、丽花蓟马 (*Frankliniella intonsa*) 等;

[0211] 膜翅目 (Hymenoptera): 蚁科 (Formicidae) 如小家蚁 (*Monomorium pharaonis*)、黑蚁 (*Formica fusca japonica*)、无毛凹臭蚁 (*Ochetellus glaber*)、双针蚁 (*Pristomyrmex pungens*)、宽结大头蚁 (*Pheidole noda*) 和阿根廷蚁 (*Linepithema humile*)，马蜂科 (long-legged wasps) 如中华长脚马蜂 (*Polistes chinensis antennalis*)、家马蜂 (*Polistes jadwigae*) 和陆马蜂 (*Polistes rothneyi*)，胡蜂科 (Vespidae) 如日本大黄蜂 (*Vespa mandarinia japonica*)、赤翅蜂 (*Vespa simillima*)、小胡蜂 (*Vespa analis insularis*)、黄边胡蜂 (*Vespa crabro flavofasciata*) 和黑尾胡蜂 (*Vespa ducalis*)，肿腿蜂科 (Bethyridae)，木蜂属 (*Xylocopa*)，蛛蜂科 (Pompilidae)，泥蜂总科 (Sphecoidae)，蜾蠃科 (mason wasp) 等;

[0212] 直翅目 (Orthoptera): 蝼蛄科 (mole crickets)、蝗总科 (grasshoppers) 等;

[0213] 蚤目 (Siphonaptera): 猫栉首蚤 (*Ctenocephalides felis*)、犬栉首蚤 (*Ctenocephalides canis*)、人蚤 (*Pulex irritans*)、印鼠客蚤 (*Xenopsylla cheopis*) 等;

[0214] 虱目 (Anoplura): 体虱 (*Pediculus humanus corporis*)、毛虱 (*Phthirus pubis*)、牛血虱 (*Haematopinus eurysternus*)、绵羊虱 (*Dalmanella ovis*) 等;

[0215] 等翅目 (Isoptera): 散白蚁属 (*Reticulitermes* spp.) 如黄胸散白蚁 (*Reticulitermes speratus*)、台湾乳白蚁 (*Coptotermes formosanus*)、欧美散白蚁 (*Reticulitermes flavipes*)、美国散白蚁 (*Reticulitermes hesperus*)、南方散白蚁 (*Reticulitermes virginicus*)、跗散白蚁 (*Reticulitermes tibialis*) 和南美异白蚁 (*Heterotermes aureus*)，楹白蚁属 (*Incisitermes* spp.) 如小楹白蚁 (*Incisitermes minor*)，以及动白蚁属 (*Zootermopsis* spp.) 如内华达古白蚁 (*Zootermopsis nevadensis*) 等;

[0216] 蜱螨目 (Acarina): 叶螨科 (Tetranychidae) 如二斑叶螨 (*Tetranychus urticae*)、神泽氏叶螨 (*Tetranychus kanzawai*)、柑橘全爪螨 (*Panonychus citri*)、苹果全爪螨 (*Panonychus ulmi*) 和小爪螨属 (*Oligonychus* spp.)，瘿螨科 (Eriophyidae) 如橘刺皮瘿螨 (*Aculops pelekassi*) 和斯氏针刺瘿螨 (*Aculus schlechtendali*)，跗线螨科 (Tarsonemidae) 如侧多食跗线螨 (*Polyphagotarsonemus latus*)、细须螨科 (Tenuipalpidae)、杜克螨科 (Tuckerellidae)，硬蜱科 (Ixodidae) 如长角血蜱 (*Haemaphysalis longicornis*)、褐黄血蜱 (*Haemaphysalis flava*)、变异革蜱 (*Dermacentor variabilis*)、卵形硬蜱 (*Ixodes ovatus*)、全沟硬蜱 (*Ixodes persulcatus*)、黑腿硬蜱 (*Ixodes scapularis*)、微小牛蜱 (*Boophilus microplus*)、美洲花蜱 (*Amblyomma americanum*) 和血红扇头蜱 (*Rhipicephalus sanguineus*)，粉螨科 (Acaridae) 如腐食酪螨 (*Tyrophagus putrescentiae*)，皮刺螨科 (Dermanyssidae) 如

粉尘螨 (*Dermatophagoides farinae*)、屋尘螨 (*Dermatophagoides pteronyssus*)、肉食螨科 (*Cheyletidae*) 如普通肉食螨 (*Cheyletus eruditus*)、马六甲肉食螨 (*Cheyletus malaccensis*) 和莫瑞肉食螨 (*Cheyletus moorei*)、鸡皮刺螨 (chicken mite) 如柏氏禽刺螨 (*Ornithonyssus bacoti*)、林禽刺螨 (*Ornithonyssus sylvarum*) 和鸡皮刺螨 (*Dermanyssus gallinae*)、恙螨科 (*Trombiculidae*) 如红纤恙螨 (*Leptotrombidium akamushi*) 等；

[0217] 蜘蛛目 (*Araneae*)：日本红蜚蛛 (*Chiracanthium japonicum*)、赤背蜘蛛 (*Latrodectus hasseltii*)、肖蛸科 (*Tetragnathidae*)、八瘤艾蛛 (*Cyclosa octotuberculata*)、悦目金蛛 (*Argiope amoena*)、横纹金蛛 (*Argiope bruennichii*)、大腹圆蛛 (*Araneus ventricosus*)、森林漏斗蛛 (*Agelena silvatica*)、黑豹蛛 (*Pardosa astrigera*)、黄褐狡蛛 (*Dolomedes sulfurous*)、黑猫跳蛛 (*Carrhotus xanthogramma*)、温室希蛛 (*Achaearana tepidariorum*)、安定隙蛛 (*Coelotes insidiosus*)、跳蛛科 (*Salticidae*)、狩猎巨蟹蛛 (*Heteropoda venatoria*) 等；

[0218] 唇足纲 (*Chilopoda*)：蜈蚣 (centipede s) 如家蚰蜒 (*Thereuonema hilgendorfi*)、越南巨人蜈蚣 (*Scolopendra subspinipes*)、日本棘蜈蚣 (*Scolopendra subspinipes japonica*)、锈红棘盲蜈蚣 (*Scolopocryptops rubiginosus*)、糙背石蜈蚣 (*Bothropolys asperatus*) 等；

[0219] 倍足纲 (*Diplopoda*)：马陆 (millipedes) 如温室马陆 (*Oxidus gracilis*)、赤马陆 (*Nedyopus tambanus*)、火车马陆 (*Parafontaria laminate*)、火车马陆 (*Parafontaria laminata armigera*)、尖齿马陆 (*Parafontaria acutidens*)、东方带马陆 (*Epanerchodus orientalis*) 等；

[0220] 等足目 (*Isopoda*)：鼠妇 (sow bugs) 如多霜蜡鼠妇 (*Porcellionides pruinosus* (Brandt))、光滑鼠妇 (*Porcellio scaber* Latreille)、球鼠妇 (pill bugs) 如普通卷甲虫 (*Armadillidium vulgare*)、海虱 (sea louses) 如海蟑螂 (*Ligia exotica*) 等；

[0221] 腹足纲 (*Gastropoda*)：树蛞蝓 (*Limax marginatus*)、黄蛞蝓 (*Limax flavus*) 等。

[0222] 本发明的害虫防治剂含有本发明的化合物和惰性载体。通常将本发明的害虫防治剂成形为下面描述的制剂。制剂的实例包括油溶液、浓缩乳剂、可湿性粉剂、可流动制剂 (例如, 水悬浮液、或水性乳浊液)、微胶囊、粉末剂、粒剂、片剂、气雾剂、二氧化碳制剂、热蒸散制剂 (例如, 杀虫盘香、电杀虫片或吸液芯型热蒸散杀虫剂)、压电杀虫制剂、热熏剂 (例如, 自燃型熏剂、化学反应型熏剂或多孔陶瓷板熏剂)、不加热的蒸散制剂 (例如, 树脂蒸散制剂、纸蒸散制剂、无纺织物蒸散制剂、针织物蒸散制剂或升华片剂)、气雾剂制剂 (例如, 雾化制剂)、直接接触制剂 (例如, 片形接触制剂、带形接触制剂或网形接触制剂)、ULV 制剂和毒饵。

[0223] 用于加工制剂的方法的实例包括以下方法。

[0224] (1) 包括将本发明的化合物与固体载体、液体载体、气态载体或毒饵混合, 之后加入表面活性剂和其他用于制剂的助剂, 并且如果需要, 进行进一步处理的方法。

[0225] (2) 包括将不含有活性成分的基底材料用本发明的化合物浸渍的方法。

[0226] (3) 包括将本发明的化合物与基底材料混合, 之后对混合物进行模制处理的方法。

[0227] 依赖于制剂形式, 这些制剂通常含有 0.001 至 98 重量% 的本发明的化合物。

[0228] 在制剂中使用的固体载体的实例包括：粘土（例如，高岭粘土、硅藻土、膨润土、Fubasami 粘土或酸性高岭土），合成含水氧化硅、滑石、陶瓷、其他无机矿物（例如，绢云母、石英、硫、活性碳、碳酸钙或含水二氧化硅）的细粉或颗粒，以及如化学肥料（例如，硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、氯化铵或尿素）之类的细粉和颗粒物质；在室温是固体的物质（例如，2,4,6-三异丙基-1,3,5-三噁烷、萘、对二氯苯或者樟脑、金刚硼）；以及包含选自以下各项组成的组中的一种或多种物质的毡、纤维、织物、编织物、薄片、纸、线、泡沫、多孔材料和复丝：羊毛、丝、棉、麻、纸浆、合成树脂（例如，聚乙烯树脂如低密度聚乙烯、直链低密度聚乙烯和高密度聚乙烯；乙烯-乙烯基酯共聚物如乙烯-乙酸乙烯酯共聚物；乙烯-甲基丙烯酸酯共聚物如乙烯-甲基丙烯酸甲酯共聚物和乙烯-甲基丙烯酸乙酯共聚物；乙烯-丙烯酸酯共聚物如乙烯-丙烯酸甲酯共聚物和乙烯-丙烯酸乙酯共聚物；乙烯-乙烯基羧酸共聚物如乙烯-丙烯酸共聚物；乙烯-四环十二碳烯共聚物；聚丙烯树脂如丙烯均聚物和丙烯-乙烯共聚物；聚-4-甲基戊烯-1，聚丁烯-1，聚丁二烯，聚苯乙烯；丙烯腈-苯乙烯树脂；丙烯腈-丁二烯-苯乙烯树脂；苯乙烯弹性体如苯乙烯-共轭二烯烃嵌段共聚物和氢化苯乙烯-共轭二烯烃嵌段共聚物；氟树脂；丙烯酸类树脂如聚甲基丙烯酸甲酯；聚酰胺树脂如尼龙6和尼龙66；聚酯树脂如聚对苯二甲酸乙二醇酯、聚萘二甲酸乙二醇酯、聚对苯二甲酸丁二醇酯和聚环己烯-对苯二甲酸二甲酯（polycyclohexylene dimethylene terephthalate）；或多孔树脂如聚碳酸酯、聚缩醛、聚丙烯酰基砜、多芳基化合物、羟基苯甲酸聚酯、聚醚亚胺、聚酯碳酸酯、聚苯撑醚树脂、聚氯乙烯、聚偏二氯乙烯、聚氨酯、泡沫聚氨酯、泡沫聚丙烯和泡沫乙烯）、玻璃、金属和陶瓷。

[0229] 液体载体的实例包括芳香族或脂族烃（例如，二甲苯、甲苯、烷基萘、苯基二甲苯基乙烷、煤油、轻油、己烷或环己烷）、卤代烃（例如，氯苯、二氯甲烷、二氯乙烷或三氯乙烷）、醇（例如，甲醇、乙醇、异丙醇、丁醇、己醇、苄醇或乙二醇）、醚（例如，二乙醚、乙二醇二甲醚、二甘醇单甲醚、二甘醇单乙醚、丙二醇单甲醚、四氢呋喃或二噁烷）、酯（例如，乙酸乙酯或乙酸丁酯）、酮（例如，丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁酮或环己酮）、腈（例如，乙腈或异丁腈）、亚砜（例如，二甲亚砜）、酰胺（例如，N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺或N-甲基-吡咯烷酮）、碳酸亚烷基酯（例如，碳酸丙二酯）、植物油（例如，大豆油或棉籽油）、植物精油（例如，橙油、海索草油或柠檬油）以及水。

[0230] 气态载体的实例包括丁烷气体、氯氟烃、液化石油气（LPG）、二甲醚和二氧化碳。

[0231] 表面活性剂的实例包括烷基硫酸盐、烷基磺酸盐、烷基芳基磺酸盐、烷基芳基醚、聚氧乙烯化的烷基芳基醚、聚乙二醇醚、多元醇酯和糖醇衍生物。

[0232] 用于加工制剂的其他助剂的实例包括粘合剂、分散剂和稳定剂。具体地有例如，酪蛋白、明胶、多糖（例如，淀粉、阿拉伯树胶、纤维素衍生物、或海藻酸）、木质素衍生物、膨润土、糖类、合成水溶性聚合物（例如，聚乙烯醇或聚乙烯基吡咯烷酮）、聚丙烯酸、BHT（2,6-二-叔丁基-4-甲酚）和BHA（2-叔丁基-4-甲氧基苯酚和3-叔丁基-4-甲氧基苯酚的混合物）。

[0233] 用于杀虫盘香的基底材料的实例包括：植物粉末如木粉和酒糟粉与粘合剂如熏香材料粉末、淀粉和谷朊的混合物。

[0234] 用于电杀虫片的基底材料的实例包括：通过硬化棉绒而获得的片和通过硬化棉绒和纸浆的混合物的原纤而获得的片。

[0235] 用于自燃型熏剂的基底材料的实例包括可燃放热试剂如硝酸盐、亚硝酸盐、胍盐、氯酸钾、硝基纤维素、乙基纤维素和木粉,热分解刺激剂如碱金属盐、碱土金属盐、重铬酸盐和铬酸盐,氧载体如硝酸钾,燃烧载剂如三聚氰胺和粉状淀粉,增量剂如硅藻土,以及粘合剂如合成胶。

[0236] 用于化学反应型熏剂的基底材料的实例包括放热试剂如碱金属硫化物、多硫化物、氢硫化物和氧化钙,催化剂如碳质材料、碳化铁和活性高岭土,有机泡沫剂如偶氮二甲酰胺、苯磺酰肼、二硝基五亚甲基四胺、聚苯乙烯和聚氨酯,以及填料如天然纤维条和合成纤维条。

[0237] 作为树脂蒸散剂的基底材料使用的树脂的实例包括聚乙烯树脂如低密度聚乙烯、直链低密度聚乙烯和高密度聚乙烯;乙烯-乙烯基酯共聚物如乙烯-乙酸乙烯酯共聚物;乙烯-甲基丙烯酸酯共聚物如乙烯-甲基丙烯酸甲酯共聚物和乙烯-甲基丙烯酸乙酯共聚物;乙烯-丙烯酸酯共聚物如乙烯-丙烯酸甲基酯共聚物和乙烯-丙烯酸乙酯共聚物;乙烯-乙烯基羧酸共聚物如乙烯-丙烯酸共聚物;乙烯-四环十二碳烯共聚物;聚丙烯树脂如丙烯共聚物和丙烯-乙烯共聚物;聚-4-甲基戊烯-1、聚丁烯-1、聚丁二烯、聚苯乙烯、丙烯腈-苯乙烯树脂;丙烯腈-丁二烯-苯乙烯树脂;苯乙烯弹性体如苯乙烯-共轭二烯嵌段共聚物和氢化的苯乙烯-共轭二烯嵌段共聚物;氟树脂;丙烯酸类树脂如聚甲基丙烯酸甲酯;聚酰胺树脂如尼龙6和尼龙66;聚酯树脂如聚对苯二甲酸乙二醇酯、聚萘二甲酸乙二醇酯、聚丁二酸丁二醇酯(polybutylene butalate)和聚环己烯-对苯二甲酸二亚甲酯;聚碳酸酯、聚缩醛、聚丙烯酰基砜、多芳基化合物、羟基苯甲酸聚酯、聚醚酰亚胺、聚酯碳酸酯、聚苯撑醚树脂、聚氯乙烯、聚偏二氯乙烯和聚氨酯。这些基底材料可以单独使用或者以两种以上类型的组合使用。如果需要,可以将增塑剂如邻苯二甲酸酯(例如,邻苯二甲酸二甲酯、邻苯二甲酸二辛酯等)、己二酸酯和硬脂酸加入至这些基底材料中。树脂蒸散剂可以通过以下方式制备:将本发明的化合物与基底材料混合、将混合物捏合、之后将其通过注塑、挤塑或压塑进行模制。如果需要,可以对所得到的树脂制剂进行进一步模制或切割步骤,以加工为如片形、膜形、带形、网形或线形之类的形状。可以将这些树脂制剂加工为动物项圈、动物耳标、薄片产品、诱捕带、园艺支架和其他产品。

[0238] 用于毒饵的基底材料的实例包括饵料成分如谷粉、植物油、糖和结晶纤维素,抗氧化剂如二丁基羟基甲苯和去甲二氢愈创木酸,防腐剂如脱氢乙酸,用于儿童和宠物的意外摄食抑制剂如辣椒粉;昆虫吸引香料如奶酪香料、洋葱香料和花生油。

[0239] 本发明的害虫防治方法通常通过将有效量的本发明的化合物以本发明的害虫防治剂的形式施加至害虫或其栖息地(例如植物体,土壤,室内,动物体,车内或户外开放空间)进行。

[0240] 用于施加本发明的害虫防治剂的方法包括以下方法,并且依赖于本发明的害虫防治剂的形式、施加面积等而适当地选择。

[0241] (1) 包括将本发明的害虫防治剂原样施加至害虫或害虫的栖息地的方法。

[0242] (2) 包括将本发明的害虫防治剂用溶剂如水稀释,之后将稀释物喷雾至害虫或害虫的栖息地的方法。

[0243] 在该方法中,通常将本发明的害虫防治剂配置为浓缩乳剂、可湿性粉剂、可流动制剂、微胶囊等。通常将该制剂稀释以使得本发明的化合物的浓度可以为0.1至10,000ppm。

[0244] (3) 将本发明的害虫防治剂在害虫的栖息地加热,从而使活性成分挥发并从害虫防治剂扩散出的方法。

[0245] 在这种情况下,本发明的化合物的施加量和浓度的任何一个可以依赖于剂型、施加周期、施加面积、施加方法、害虫的种类、所招致的破坏等适当地确定。

[0246] 当本发明的化合物用于时疫的预防时,在施加至空间的情况下所施加的量通常为 0.0001 至 1,000mg/m<sup>3</sup> 的本发明的化合物,并且在施加至平面的情况下为 0.0001 至 1,000mg/m<sup>2</sup> 的本发明的化合物。取决于制剂的形式,杀虫盘香或电杀虫片通过加热使活性成分挥发并扩散,以达到应用。使树脂蒸散剂、纸蒸散剂、无纺织物蒸散剂、针织物蒸散剂或升华片剂在所要施加的空间中原样静置,并且在空气吹动之下放置。

[0247] 当出于防止时疫的目的而将本发明的害虫防治剂施加至空间时,空间的实例包括壁橱、日本橱、日本柜、碗橱、厕所、浴室、货棚、起居室、餐室、车库、汽车内部等。也可以将害虫防治剂施加至户外开放空间。

[0248] 当本发明的害虫防治剂用于防治家畜如牛、马、猪、绵羊、山羊和鸡和小动物如狗、猫、大鼠和小鼠的外部寄生虫时,可以将本发明的害虫防治剂通过兽医领域中的已知方法施加至这些动物。具体地,当需要系统防治时,将本发明的害虫防治剂作为片剂、与饲料混合物或栓剂,或通过注入(包括肌肉、皮下、静脉和腹膜注入)给药至动物。另一方面,当需要非系统防治时,将本发明的害虫防治剂通过以下方式施加至动物:油溶液或水溶液的喷雾、倾倒或涂抹处理,或用洗发剂洗涤动物,或将由树脂蒸散剂制成的项圈或耳标放置至动物。在给药至动物体的情况下,本发明的化合物的剂量通常在每 1kg 的动物体重为 0.1 至 1,000mg 的范围内。

[0249] 当本发明的害虫防治剂用于防治农田中的害虫时,用量可以取决于施加周期、施加面积、施加方法和其他因素而宽范围地变化,并且以每 10,000m<sup>2</sup> 本发明的化合物计通常在 1 至 10,000g 的范围内。当将本发明的害虫防治剂配置为浓缩乳剂、可湿性粉剂、可流动制剂等时,通常将害虫防治剂在用水稀释以使得活性成分的浓度成为 0.01 至 10,000ppm 之后施加,并且通常将颗粒或粉剂按原样施加。

[0250] 可以将这些制剂或制剂的水稀释物直接喷雾在害虫或要保护其不受害虫影响的植物如作物植物上,或者可以将其在土壤处理中使用以防治栖息在耕地的土壤上的害虫。

[0251] 施加也可以通过以下方法进行:直接将形成为片形、或线形或绳形制剂的树脂制剂卷在植物周围,将制剂放置在植物附近,或者将制剂散布在根处的土壤表面上。

[0252] 可以将本发明的化合物用作耕地如农场、稻田、草坪或果园,或未耕种的地中的害虫防治剂。本发明的化合物可以在种植以下“植物作物”的耕地中防治栖息在耕地中的害虫。

[0253] 农作物:玉米、稻、小麦、大麦、黑麦、燕麦、高粱、棉花、大豆、花生、荞麦、糖用甜菜、油菜籽、向日葵、糖用甘蔗、烟草等;

[0254] 蔬菜:茄科(Solanaceae)植物(茄子、番茄、青椒、辣椒、土豆等)、葫芦科(Cucurbitaceae)植物(黄瓜、南瓜、西葫芦、西瓜、甜瓜等)、十字花科(Cruciferae)植物(白萝卜(Japanese radish)、芜菁、辣根、擘菜、大白菜、甘蓝、芥菜、西兰花、花椰菜等)、菊科(Compositae)植物(牛蒡、茼蒿、洋蓟、莴苣等)、百合科(Liliaceae)植物(大葱、洋葱、蒜、芦笋等)、伞形科(Umbelliferae)植物(胡萝卜、欧芹、芹菜、欧防风等)、藜科

(Chenopodiaceae) 植物 (菠菜、厚皮菜等)、唇形科 (Labiatae) 植物 (日本紫苏、薄荷、罗勒等)、草莓、甘薯、山药、天南星科植物等；

[0255] 果树：梨果类 (苹果、西洋梨、沙梨、木瓜、榲桲等)、核果类 (桃、洋李、桃驳李、日本梅、樱桃、杏、李等)、柑果类 (温州蜜柑、橘、柠檬、来檬、葡萄柚等)；坚果类 (栗、胡桃、榛、杏仁、阿月浑子、腰果、澳洲坚果等)、浆果类 (越橘、蔓越莓、黑莓、复盆子等)、葡萄、柿、橄榄、枇杷、香蕉、咖啡、海枣、椰子、油棕等；

[0256] 除果树外的其他树：茶、桑、木本植物 (杜鹃花、山茶、绣球、茶梅、八角茴香 (*Illicium religiosum*)、樱树、鹅掌楸、紫薇、木犀等)、行道树 (栲、桦木、株木、桉、银杏、丁香、枫树、栎、杨、紫荆、枫香、悬铃木、榉树、日本香柏、冷杉、日本铁杉、刺柏、松、云杉、红豆杉、榆、七叶树等)、莢蒾、罗汉松 (*Podocarpus macrophyllus*)、日本柳杉、日本扁柏、巴豆、卫矛、山楂等；

[0257] 草坪：结缕草 (日本结缕草、沟叶结缕草等)、狗牙根 (双花狗牙根 (*Cynodon dactylon*) 等)、剪股颖 (普通剪股颖、匍匐剪股颖 (*Agrostis stolonifera*)、细弱剪股颖 (*Agrostis tenuis*) 等)、早熟禾 (草地早熟禾、普通早熟禾等)、羊茅 (巨羊茅、紫羊茅、匍匐紫羊茅等)、黑麦草 (毒麦、黑麦草等)、鸭茅、梯牧草等；

[0258] 其他：花 (蔷薇、康乃馨、菊、洋桔梗 (紫色洋桔梗)、丝石竹、扶郎花、金盏花、鼠尾草、碧冬茄、马鞭草、郁金香、紫菀、龙胆、百合、三色堇、仙客来、红门兰、铃兰、薰衣草、紫罗兰、芸薹、报春花、一品红、唐菖蒲、卡特兰、雏菊、马鞭草、兰、秋海棠等)、生物燃料植物 (麻风树、红蓝花、亚麻茅、柳枝稷、芒 (*Miscanthus*)、藨草、芦竹、大麻槿、木薯、柳等)、观赏叶植物等。

[0259] 以上“植物作物”包括转基因植物作物。

[0260] 本发明的化合物可以与其他杀昆虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、土壤害虫防治剂、杀真菌剂、除草剂、植物生长调节剂、驱避剂、增效剂、肥料或土壤改性剂混合或组合使用。

[0261] 这种杀昆虫剂和杀螨剂的活性成分的实例包括：

[0262] (1) 合成拟除虫菊酯化合物：

[0263] 氟丙菊酯 (acrinathrin)、烯丙菊酯 (allethrin)、高效氟氯氰菊酯 (beta-cyfluthrin)、联苯菊酯 (bifenthrin)、乙氰菊酯 (cycloprothrin)、氟氯氰菊酯 (cyfluthrin)、氯氟氰菊酯 (cyhalothrin)、氯氰菊酯 (cypermethrin)、右旋烯炔菊酯 (empenthrin)、溴氰菊酯 (deltamethrin)、S- 氰戊菊酯 (esfenvalerate)、醚菊酯 (ethofenprox)、甲氰菊酯 (fenpropathrin)、氰戊菊酯 (fenvalerate)、氟氰戊菊酯 (flucythrinate)、三氟醚菊酯 (flufenoprox)、氟氯苯菊酯 (flumethrin)、氟胺氰菊酯 (fluvalinate)、苄呋醚 (halfenprox)、炔咪菊酯 (imiprothrin)、氯菊酯 (permethrin)、右旋烯丙菊酯 (prallethrin)、除虫菊素 (pyrethrins)、苄呋菊酯 (resmethrin)、高效氯氟氰菊酯 (sigma-cypermethrin)、氟硅菊酯 (silaflofen)、七氟菊酯 (tefluthrin)、四溴菊酯 (tralomethrin)、四氟苯菊酯 (transfluthrin)、胺菊酯 (tetramethrin)、苯醚菊酯 (phenothrin)、苯醚氰菊酯 (cyphenothrin)、顺式氯氟氰菊酯 (alpha-cypermethrin)、zeta- 氯氟氰菊酯 (zeta-cypermethrin)、高效氯氟氰菊酯 (lambda-cyhalothrin)、精高效氯氟氰菊酯 (gamma-cyhalothrin)、炔呋菊酯 (furamethrin)、氟胺氰菊酯 (tau-fluvalinate)、甲氧苄氟菊酯 (metofluthrin)、2,2- 二甲基 -3-(1- 丙烯基) 环丙烷

甲酸 [2,3,5,6-四氟-4-甲基苄基]酯、2,2-二甲基-3-(2-甲基-1-丙烯基)环丙烷甲酸 [2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苄基]酯、2,2,3,3-四甲基环丙烷甲酸 [2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苄基]酯等；

[0264] (2) 有机磷化合物：

[0265] 乙酰甲胺磷 (acephate)、磷化铝 (Aluminium phosphide)、脱甲基丁噻啉磷 (butathiofos)、硫线磷 (cadusafos)、氯氧磷 (chlorethoxyfos)、毒虫畏 (chlorfenvinphos)、毒死蜱 (chlorpyrifos)、甲基毒死蜱 (chlorpyrifos-methyl)、杀螟腈 (cyanophos:CYAP)、二嗪磷 (diazinon)、DCIP(二氯二异丙醚)、除线磷 (dichlofenthion:ECP)、敌敌畏 (dichlorvos:DDVP)、乐果 (dimethoate)、甲基毒虫畏 (dimethylvinphos)、乙拌磷 (disulfoton)、苯硫磷 (EPN)、乙硫磷 (ethion)、灭线磷 (ethoprophos)、乙嘧硫磷 (etrimfos)、倍硫磷 (fenthion:MPP)、杀螟硫磷 (fenitrothion:MEP)、噻唑磷 (fosthiazate)、安硫磷 (formothion)、磷化氢 (hydrogen phosphide)、异柳磷 (isofenphos)、噁唑磷 (isoxathion)、马拉硫磷 (malathion)、倍硫磷亚砷 (mesulfenfos)、杀扑磷 (methidathion:DMTP)、久效磷 (monocrotophos)、二溴磷 (naled:BRP)、异砷磷 (oxydeprofos:ESP)、对硫磷 (parathion)、伏杀硫磷 (phosalone)、亚胺硫磷 (phosmet:PMP)、甲基嘧啉磷 (pirimiphos-methyl)、哒嗪硫磷 (pyridafenthion)、喹硫磷 (quinalphos)、稻丰散 (phenthoate:PAP)、丙溴磷 (profenfos)、丙虫磷 (propaphos)、丙硫磷 (prothiofos)、吡啉硫磷 (pyraclorfos)、蔬果磷 (salithion)、硫丙磷 (sulprofos)、丁基嘧啉磷 (tebupirimfos)、双硫磷 (temephos)、杀虫畏 (tetrachlorvinphos)、特丁硫磷 (terbufos)、甲基乙拌磷 (thiometon)、敌百虫 (trichlorphon:DEP)、蚜灭磷 (vamidothion)、甲拌磷 (phorate)、硫线磷 (cadusafos) 等；

[0266] (3) 氨基甲酸酯化合物：

[0267] 棉铃威 (alanycarb)、噁虫威 (bendiocarb)、丙硫克百威 (benfuracarb)、仲丁威 (BPMC)、甲萘威 (carbaryl)、克百威 (carbofuran)、丁硫克百威 (carbosulfan)、除线威 (cloethocarb)、乙硫苯威 (ethiofencarb)、仲丁威 (fenobucarb)、苯硫威 (fenothiocarb)、苯氧威 (fenoxycarb)、呋线威 (furathiocarb)、异丙威 (isoprocarb:MIPC)、速灭威 (metolcarb)、灭多威 (methomyl)、甲硫威 (methiocarb)、甲萘威 (NAC)、杀线威 (oxamyl)、抗蚜威 (pirimicarb)、残杀威 (propoxur:PHC)、灭除威 (XMC)、硫双威 (thiodicarb)、灭杀威 (xylylcarb)、涕灭威 (aldicarb) 等；

[0268] (4) 沙蚕毒素 (nereistoxin) 化合物：

[0269] 杀螟丹 (cartap)、杀虫磺 (bensultap)、杀虫环 (thiocyclam)、杀虫单 (monosultap)、杀虫双 (bisultap) 等；

[0270] (5) 新烟碱类化合物：

[0271] 吡虫啉 (imidacloprid)、烯啉虫胺 (nitenpyram)、啉虫脒 (acetamiprid)、噻虫嗪 (thiamethoxam)、噻虫啉 (thiacloprid)、呋虫胺 (dinotefuran)、噻虫胺 (clothianidin) 等；

[0272] (6) 苯甲酰基脲化合物：

[0273] 氟啉脲 (chlorfluazuron)、双二氟虫脲 (bistrifluron)、丁醚脲 (diafenthiuron)、除虫脲 (diflubenzuron)、啉啉脲 (fluazuron)、氟环脲

(flucycloxuron)、氟虫脲 (flufenoxuron)、氟铃脲 (hexaflumuron)、虱螨脲 (lufenuron)、氟酰脲 (novaluron)、多氟脲 (noviflumuron)、氟苯脲 (teflubenzuron)、杀铃脲 (triflumuron)、啉蚜威 (triazuron) 等；

[0274] (7) 苯基吡唑化合物：

[0275] 乙酰虫腈 (acetoprole)、乙虫腈 (ethiprole)、氟虫腈 (fipronil)、甲烯氟虫腈 (vaniliprole)、吡啶氟虫腈 (pyriprole)、吡嗪氟虫腈 (pyrafluprole) 等；

[0276] (8) Bt 毒素杀昆虫剂：

[0277] 得自苏云金杆菌 (*Bacillus thuringiensis*) 的活孢子和由苏云金杆菌制备的晶体毒素, 以及它们的混合物；

[0278] (9) 脞化合物：

[0279] 环虫酰脞 (chromafenozide)、氯虫酰脞 (halofenozide)、甲氧虫酰脞 (methoxyfenozide)、虫酰脞 (tebufenozide) 等；

[0280] (10) 有机氯化物：

[0281] 艾氏剂 (aldrin)、狄氏剂 (dieldrin)、遍地克 (dienochlor)、硫丹 (endosulfan)、甲氧滴滴涕 (methoxychlor) 等；

[0282] (11) 天然杀昆虫剂：

[0283] 机油、硫酸烟碱 (nicotine-sulfate)；

[0284] (12) 其他杀昆虫剂：

[0285] 阿维菌素 (avermectin-B)、溴螨酯 (bromopropylate)、噻嗪酮 (buprofezin)、虫螨腈 (chlorphenapyr)、灭蝇胺 (cyromazine)、1,3-二氯丙烯 (D-D)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐 (emamectin-benzoate)、啉螨醚 (fenazaquin)、吡氟硫磷 (flupyrazofos)、烯虫乙酯 (hydroprene)、烯虫酯 (methoprene)、茚虫威 (indoxacarb)、噁虫酮 (metoxadiazone)、弥拜菌素 (milbemycin-A)、吡蚜酮 (pymetrozine)、啉虫醚 (pyridalyl)、吡丙醚 (pyriproxyfen)、多杀霉素 (spinosad)、氟虫胺 (sulfluramid)、啉虫酰胺 (tolfenpyrad)、啉蚜威 (triazamate)、氟虫酰胺 (flubendiamide)、林皮没丁 (lepimectin)、砷酸、异噁虫啉 (benclonthiaz)、氰氨化钙、多硫化钙、氯丹 (chlordane)、滴滴涕 (DDT)、DSP、噁虫胺 (flufenerim)、氟啉虫酰胺 (flonicamid)、噁虫胺 (flurimfen)、伐虫脞 (formetanate)、安百亩 (metam-ammonium)、威百亩 (metam-sodium)、溴甲烷 (methyl bromide)、油酸钾、丙苯炔菊酯 (protrifenbute)、螺甲螨酯 (spiromesifen)、硫、氰氟虫腙 (metaflumizone)、螺虫乙酯 (spirotetramat)、氟虫吡啶 (pyrifluquinazone)、乙基多杀菌素 (spinetoram)、氯虫苯甲酰胺 (chlorantraniliprole)、溴螺腈 (tralopyril) 等。

[0286] 驱避剂的活性成分的实例包括 N, N'-二乙基-间-甲苯酰胺、苧烯、里哪醇、香茅醛、薄荷醇、薄荷酮、4-异丙基环庚二烯酚酮、香茅醇、桉叶油素、茚虫威 (indoxacarb)、萘-3,4-二醇、MGK-R-326、MGK-R-874 和 BAY-KBR-3023。

[0287] 增效剂的活性成分的实例包括 5-[2-(2-丁氧基乙氧基)乙氧基甲基]-6-丙基-1,3-苯并间二氧杂环戊烯 (benzodioxol)、N-(2-乙基己基)双环[2.2.1]庚-5-烯-2,3-二羧酰亚胺、八氯二丙基醚、硫代氰基乙酸异冰片基、N-(2-乙基己基)-1-异丙基-4-甲基双环[2.2.2]辛-5-烯-2,3-二羧酰亚胺。



## 实施例

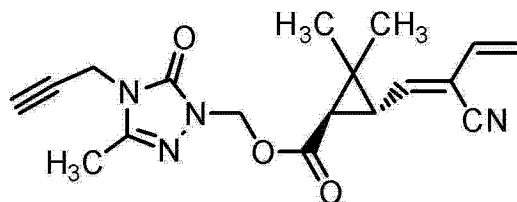
[0288] 在下文中,将通过制备例、制剂例和测试例更详细地描述本发明,但本发明不限于此。

[0289] 首先,将描述本发明的化合物的制备例。

[0290] 制备例 1

[0291] 向 2-羟甲基-5-甲基-4-(2-丙炔基)-2,4-二氢-[1,2,4]三唑-3-酮 (450mg, 2.69mmol) 和 (1R)-反式-3-[(1Z)-2-氰基-1,3-丁二烯基]-2,2-二甲基环丙烷甲酸 (540mg, 3.00mmol) 的氯仿溶液 (10mL) 加入 1-乙基-3-(3-二甲基氨基丙基)碳二亚胺盐酸盐 (0.63g, 3.31mmol) 和 4-二甲基氨基吡啶 (15mg)。在将混合物在室温搅拌 24 小时之后,将水倒入至反应混合物中并且将溶液用乙酸乙酯萃取。将有机层用硫酸镁干燥,之后在减压下浓缩,并且对残留物进行硅胶层析,获得 239mg 的由下式表示的 (1R)-反式-3-[(1Z)-2-氰基-1,3-丁二烯基]-2,2-二甲基环丙烷甲酸 {3-甲基-5-氧代-4-(2-丙炔基)-4,5-二氢-[1,2,4]三唑基甲基} 酯 (在下文中称为本发明的化合物 (1))。

[0292]

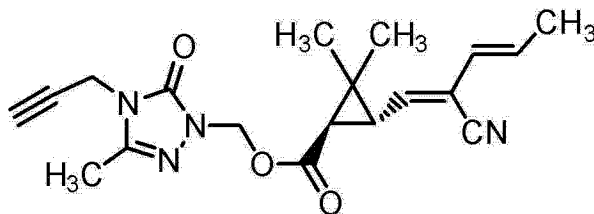


[0293] 白色结晶:<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>, TMS) δ (ppm) :1.22(s, 3H), 1.36(s, 3H), 1.82(d, 1H), 2.35(s, 3H), 2.36(m, 1H), 2.55(m, 1H), 4.43(d, 2H), 5.30(d, 1H), 5.61(d, 1H), 5.75(dd, 2H), 5.93(d, 1H), 6.24(dd, 1H)。

[0294] 制备例 2

[0295] 除了使用 (1R)-反式-3-[(1Z,3E)-2-氰基-1,3-戊二烯基]-2,2-二甲基环丙烷甲酸代替 (1R)-反式-3-[(1Z)-2-氰基-1,3-丁二烯基]-2,2-二甲基环丙烷甲酸之外,以与制备例 1 相同的方式进行操作,获得由下式表示的 (1R)-反式-3-[(1Z,3E)-2-氰基-1,3-戊二烯基]-2,2-二甲基环丙烷甲酸 {3-甲基-5-氧代-4-(2-丙炔基)-4,5-二氢-[1,2,4]三唑基甲基} 酯 (在下文中称为本发明的化合物 (2))

[0296]



[0297] 浅黄色液体:<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>, TMS) δ (ppm) :1.21(s, 3H), 1.34(s, 3H), 1.77(d, 1H), 1.81(m, 3H), 2.35(s, 3H), 2.36(m, 1H), 2.52(m, 1H), 4.43(d, 2H), 5.75(dd, 2H), 5.78(m, 1H), 5.95(d, 1H), 6.10(m, 1H)。

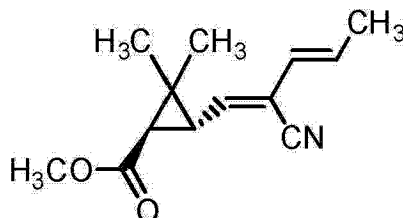
[0298] 下面将关于羧酸化合物 (3) 的制备描述参考制备例。

[0299] 参考制备例 1

[0300] 将 (1R)-反式-3-甲酰基-2,2-二甲基环丙烷甲酸甲酯 (2.53g, 16.2mmol), 3-戊

腈 (1.90g, 23.5mmol) 和无水碳酸钾 (3.22g, 23.3mmol) 加入至 30mL 的 N,N-二甲基甲酰胺中, 并且将混合物在室温搅拌 24 小时。将反应溶液加入至 100mL 的冰水中, 并且将溶液用每次 100mL 的乙酸乙酯萃取两次。将所获得的乙酸乙酯层合并, 用 50mL 的饱和盐水洗涤一次, 之后用硫酸镁干燥。在减压条件下浓缩之后, 将残留物进行硅胶柱层析, 获得 0.94g 的由下式表示的 (1R)-反式-3-[(1Z,3E)-2-氰基-1,3-戊二烯基]-2,2-二甲基环丙烷甲酸甲酯:

[0301]

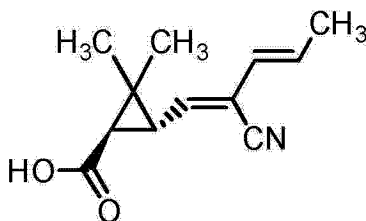


[0302] 无色液体:<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>, TMS) δ (ppm): 1.22 (s, 3H), 1.35 (s, 3H), 1.75 (d, 1H, J = 5.2Hz), 1.82 (d, 3H, J = 5.2Hz), 2.5 (m, 1H, J = 10.0, 5.2Hz), 3.7 (s, 3H), 5.82 (d, 1H, J = 10.0Hz), 5.96 (d, 1H, J = 16.8Hz), 6.10 (m, 1H)

[0303] 参考制备例 2

[0304] 将 (1R)-反式-3-[(1Z,3E)-2-氰基-1,3-戊二烯基]-2,2-二甲基环丙烷甲酸甲酯 (502mg, 2.29mmol) 溶解在 3mL 甲醇和 1mL 水的混合液体中, 之后加入氢氧化钾 (300mg, 5.36mmol), 并且将混合溶液在室温搅拌 24 小时。将反应溶液加入至 20mL 的冰水中, 并且将溶液用 20mL 的乙酸乙酯萃取。向所获得的水层加入 5% 盐酸直至 pH 成为 2, 之后将溶液用 30mL 的乙酸乙酯萃取。将乙酸乙酯层用 20mL 的饱和盐水洗涤两次, 之后用硫酸镁干燥。在减压条件下浓缩之后, 获得 452mg 的由下式表示的 (1R)-反式-3-[(1Z,3E)-2-氰基-1,3-戊二烯基]-2,2-二甲基环丙烷甲酸:

[0305]

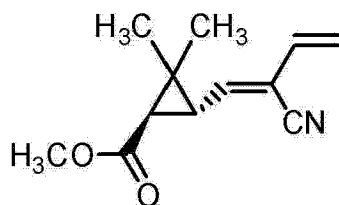


[0306] 无色液体:<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>, TMS) δ (ppm): 1.23 (s, 3H), 1.38 (s, 3H), 1.76 (d, 1H, J = 5.2Hz), 1.82 (d, 3H, J = 6.4Hz), 2.54 (dd, 1H, J = 10.0, 5.2Hz), 5.82 (d, 1H, J = 10.0Hz), 5.97 (d, 1H, J = 15.6Hz), 6.11 (m, 1H)

[0307] 参考制备例 3

[0308] 将 (1R)-反式-3-甲酰基-2,2-二甲基环丙烷甲酸甲酯 (2.53g, 16.2mmol)、3-丁腈 (3.62g, 54.0mmol) 和无水碳酸钾 (3.22g, 23.3mmol) 加入至 30mL 的 N,N-二甲基甲酰胺中, 并且将混合物在室温搅拌 24 小时。将反应溶液加入至 100mL 的冰水中, 并且将溶液用每次 100mL 的乙酸乙酯萃取两次。将乙酸乙酯层合并, 用 50mL 的饱和盐水洗涤一次, 之后用硫酸镁干燥。在减压条件下浓缩之后, 将残留物进行硅胶柱层析, 获得 0.37g 的由下式表示的 (1R)-反式-3-[(1Z)-2-氰基-1,3-丁二烯基]-2,2-二甲基环丙烷甲酸甲酯:

[0309]

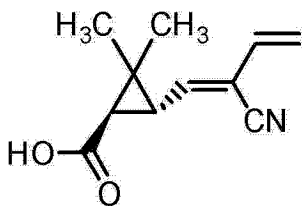


[0310] 无色液体：<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>, TMS) δ (ppm) :1.24(s, 3H), 1.35(s, 3H), 1.81(d, 1H, J = 5.2Hz), 2.54(dd, 1H, J = 10.4, 5.2Hz), 3.71(s, 3H), 5.30(d, 1H, J = 10.8Hz), 5.61(d, 1H, J = 17.2Hz), 5.98(d, 1H, 10.4Hz), 6.26(dd, 1H, J = 10.4, 17.2Hz)

[0311] 参考制备例 4

[0312] 将 (1R)-反式-3-[(1Z)-2-氰基-1,3-丁二烯基]-2,2-二甲基环丙烷甲酸甲酯 (483mg, 2.36mmol) 溶解在 3mL 四氢呋喃和 1mL 水的混合液体中, 之后加入氢氧化钾 (215mg, 3.84mmol) 并且将溶液在室温搅拌 24 小时。将反应溶液加入至 20mL 的冰水中, 并且将溶液用 20mL 的乙酸乙酯萃取。向所获得的水层加入 5% 盐酸直至 pH 成为 2, 之后将溶液用 30mL 的乙酸乙酯萃取。将乙酸乙酯层用 20mL 的饱和盐水洗涤两次, 之后用硫酸镁干燥。在减压条件下浓缩之后, 获得 440mg 的由下式表示的 (1R)-反式-3-[(1Z)-2-氰基-1,3-丁二烯基]-2,2-二甲基环丙烷甲酸:

[0313]

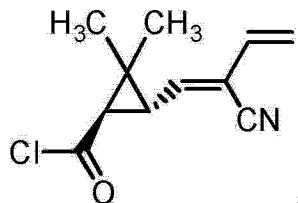


[0314] 无色液体：<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>, TMS) δ (ppm) :1.25(s, 3H), 1.38(s, 3H), 1.82(d, 1H, J = 5.2Hz), 2.56(dd, 1H, J = 10.4, 5.2Hz), 5.32(d, 1H, J = 10.8Hz), 5.62(d, 1H, J = 17.2Hz), 6.01(d, 1H, 10.4Hz), 6.25(dd, 1H, J = 10.4, 17.2Hz)

[0315] 参考制备例 5

[0316] 将 (1R)-反式-3-[(1Z)-2-氰基-1,3-丁二烯基]-2,2-二甲基环丙烷甲酸 (440mg, 2.30mmol) 溶解在 3mL 的四氢呋喃中, 之后加入亚硫酸氯 (301mg, 2.53mmol) 和 10mg 的 N, N-二甲基甲酰胺, 并且将溶液在室温搅拌 1 小时, 并且进一步在 60°C 搅拌 3 小时。将反应溶液在减压条件下浓缩, 获得 460mg 的由下式表示的 (1R)-反式-3-[(1Z)-2-氰基-1,3-丁二烯基]-2,2-二甲基环丙烷甲酰氯:

[0317]



[0318] 其为浅黄色液体。

[0319] 下面显示制剂例。份数以质量计。

[0320] 制剂例 1

[0321] 将二十 (20) 份的本发明的化合物 (1) 至 (2) 的每一个溶解在 65 份的二甲苯中, 并

且将 15 份的 SOLPOL 3005X(TOHO Chemical Industry Co., Ltd. 的注册商标) 加入其中, 并且通过搅拌彻底混合以获得浓缩乳剂。

[0322] 制剂例 2

[0323] 将五 (5) 份的 SORPOL 3005X 加入至 40 份的本发明的化合物 (1) 至 (2) 的每一个中, 并将混合物彻底混合, 并且将 32 份的 CARPLEX#80(合成的含水氧化硅, SHIONOGI & CO., LTD. 的注册商标) 和 23 份的 300 目硅藻土加入其中, 之后通过混合器的搅拌混合, 获得可湿性粉剂。

[0324] 制剂例 3

[0325] 将 1.5 份的本发明的化合物 (1) 至 (2) 的每一个、1 份的 TOKUSIL GUN(合成的含水氧化硅, 由 Tokuyama Corporation 生产)、2 份的 REAX 85A(木素磺酸钠, 由 West Vaco Chemicals 生产)、30 份的 BENTONITE FUJI(膨润土, 由 Houjun 生产) 和 65.5 份的 SHOUKOUZAN A 粘土(高岭粘土, 由 Shoukouzan Kougyousho 生产) 的混合物彻底磨成粉末并混合, 并且将水加入其中。将混合物彻底捏合, 通过挤出造粒机造粒, 之后干燥以获得 1.5% 的颗粒剂。

[0326] 制剂例 4

[0327] 向 10 份的本发明的化合物 (1) 至 (2) 的每一个、10 份的苯基二甲苯基乙烷和 0.5 份的 SUMIDUR L-75(甲苯二异氰酸酯, 由 Sumitomo Bayer Urethane Co., Ltd. 生产) 的混合物中, 加入 20 份的 10% 阿拉伯树胶水溶液中, 并且将混合物用均化器搅拌以获得具有 20  $\mu\text{m}$  的平均粒径的乳浊液。向乳浊液加入 2 份乙二醇并且将混合物在 60°C 温度的温浴中进一步搅拌 24 小时以获得微胶囊浆液。另一方面, 将 0.2 份的黄原胶和 1.0 份的 VEEGUMR(硅酸镁铝, 由 Sanyo Chemical Industries, Ltd. 生产) 分散在 56.3 份的离子交换水中以获得增稠液。之后, 将 42.5 份的上述微胶囊浆液和 57.5 份的上述增稠液混合以获得微胶囊。

[0328] 制剂例 5

[0329] 将 10 份的本发明的化合物 (1) 至 (2) 的每一个和 10 份的苯基二甲苯基乙烷的混合物加入至 20 份的 10% 聚乙二醇水溶液中, 并且将混合物通过混合器搅拌以获得具有 3  $\mu\text{m}$  的平均粒径的乳浊液。另一方面, 将 0.2 份的黄原胶和 1.0 份的 VEEGUM R(硅酸铝镁, 由 Sanyo Chemical Industries, Ltd. 生产) 分散在 58.8 份的离子交换水中以获得增稠液。之后, 将 40 份的上述乳浊液溶液和 60 份的上述增稠液混合以获得可流动制剂。

[0330] 制剂例 6

[0331] 向 5 份的本发明的化合物 (1) 至 (2) 的每一个中, 加入 3 份的 CARPLEX#80(合成的含水氧化硅, SHIONOGI & CO., LTD. 的注册商标)、0.3 份的 PAP(磷酸单异丙酯和磷酸二异丙酯的混合物) 和 91.7 份的滑石(300 目), 将混合物通过混合器搅拌以获得粉剂。

[0332] 制剂例 7

[0333] 将零点一 (0.1) 份的本发明的化合物 (1) 至 (2) 的每一个溶解在 10 份的二氯甲烷中, 并将溶液与 89.9 份的脱臭煤油混合以获得油溶液。

[0334] 制剂例 8

[0335] 将零点一 (0.1) 份的本发明的化合物 (1) 至 (2) 的每一个和 39.9 份的脱臭煤油混合并溶解, 并且将溶液填充至气雾剂容器中, 并安装阀门部分。之后, 将 60 份的能量推进

剂（液化石油气）在压力下通过阀门部分填充在其中，以获得油基气雾剂制剂。

[0336] 制剂例 9

[0337] 将零点六 (0.6) 份的本发明的化合物 (1) 至 (2) 的每一个、5 份的二甲苯、3.4 份的脱臭煤油和 1 份的 Reodol MO-60 (乳化剂, Kao Corporation 的注册商标) 混合并溶解, 并且将溶液和 50 份的水填充至气雾剂容器中, 之后将 40 份的能量推进剂 (液化石油气) 在压力下通过阀门部分填入其中, 获得水性气雾剂制剂。

[0338] 制剂例 10

[0339] 将零点三 (0.3) g 的本发明的化合物 (1) 至 (2) 的每一个溶解在 20mL 的丙酮中, 并将溶液在搅拌下与 99.7g 的用于盘香的基底材料 (通过将 Tabu 粉、除虫菊渣和木粉以 4 : 3 : 3 的比例混合获得) 均匀混合。之后, 将 100mL 的水加入其中, 并且将混合物彻底捏合、干燥并模制以获得杀虫盘香。

[0340] 制剂例 11

[0341] 将 0.8g 的本发明的化合物 (1) 至 (2) 的每一个和 0.4g 的胡椒基丁醚的混合物溶解在丙酮中, 并将总体积调节至 10ml。之后, 将 0.5mL 的该溶液均匀地浸渍至具有 2.5cm×1.5cm 的尺寸和 0.3cm 的厚度的用于电加热杀虫片的基底材料 (将棉绒和纸浆的混合物的原纤硬化而获得的垫) 中, 以获得电加热杀虫垫。

[0342] 制剂例 12

[0343] 将通过由 3 份的本发明化合物 (1) 至 (2) 的每一个溶解在 97 份的脱臭煤油中获得的溶液倒入至由氯乙烯制成的容器中。将其上部可以通过加热器加热的吸液芯 (用粘合剂硬化并烧结的无机碎粉) 插入其中, 以获得用于吸液芯型热蒸发装置使用的部件。

[0344] 制剂例 13

[0345] 将一百 (100)mg 的本发明化合物 (1) 至 (2) 的每一个溶解在适当量的丙酮中, 并将溶液浸透至具有 4.0cm×4.0cm 的尺寸和 1.2cm 的厚度的多孔陶瓷板中以获得热熏剂。

[0346] 制剂例 14

[0347] 将一百 (100)  $\mu$ g 的本发明化合物 (1) 至 (2) 的每一个溶解在适当量的丙酮中, 并将溶液均匀地施加至具有 2cm×2cm 的尺寸和 0.3mm 的厚度的滤纸, 并且空气干燥以移除丙酮, 从而获得用于在室温使用的挥发性试剂。

[0348] 制剂例 15

[0349] 十 (10) 份的本发明化合物 (1) 至 (2) 的每一个、35 份含有 50 份的聚氧乙烯烷基醚硫酸铵盐的白炭黑, 以及 55 份的水混合, 之后通过湿磨法磨细以获得 10% 的制剂。

[0350] 接下来, 通过测试例说明本发明的化合物作为害虫防治剂的活性成分是有效的。

[0351] 测试例 1

[0352] 将零点零零六二五 (0.00625) 份的本发明的化合物 (1) 和 (2) 各自溶解在 10 份的异丙醇中, 并且将溶液与 89.99375 份的脱臭煤油混合以制备 0.00625% (w/v) 油溶液。

[0353] 将十只成年德国小蠊 (*Blattella germanica*, 5 只雄性和 5 只雌性) 释放在其内表面上涂布有黄油的测试容器中 (直径 8.75cm, 高 7.5cm, 底部表面由 16 目金属线制成), 并且将容器放置在测试室的底部上 (底部表面: 46cm×46cm, 高度: 70cm)。

[0354] 使用喷雾枪以 0.4kg/cm<sup>2</sup> 的压力从高于容器顶面 60cm 之处喷雾各自 1.5mL 的本发明的化合物 (1) 和 (2) 的油溶液。在喷雾之后三十秒, 将容器从室内拉出。在喷雾之后

两分钟,数出击倒的蟑螂的数目并且确定击倒率(重复一次)。通过以下公式计算击倒率。

[0355] 击倒率(%) = (击倒的蟑螂的数目 / 测试蟑螂的数目) × 100 结果(喷雾之后 2 分钟)在表 1 中给出。

[0356] 表 1

[0357]

测试化合物	喷雾之后 2 分钟的击倒率 (%)
本发明的化合物 (1)	100
本发明的化合物 (2)	100

[0358] 工业实用性

[0359] 本发明的化合物具有出色的害虫防治效果,因此可用作害虫防治剂的活性组分。