



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 111909143 B

(45) 授权公告日 2021.10.29

(21) 申请号 202010754471.7

(22) 申请日 2020.07.30

(65) 同一申请的已公布的文献号

申请公布号 CN 111909143 A

(43) 申请公布日 2020.11.10

(73) 专利权人 山东省联合农药工业有限公司

地址 250100 山东省泰安市范镇大辛村胜利路中段路南1号楼

(72) 发明人 唐剑峰 迟会伟 吴建挺 于斌
徐龙祥 赵宝修 杨绎 李冬蓉

(74) 专利代理机构 北京知元同创知识产权代理有限公司 (普通合伙) 11535

代理人 谢蓉

(51) Int. Cl.

C07D 413/12 (2006.01)

A01N 43/80 (2006.01)

A01P 7/02 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

A01P 5/00 (2006.01)

(56) 对比文件

CN 101768129 A, 2010.07.07

CN 101400662 A, 2009.04.01

CN 102088856 A, 2011.06.08

WO 2020064565 A1, 2020.04.02

CN 104066330 A, 2014.09.24

CN 102131789 A, 2011.07.20

CN 101778566 A, 2010.07.14

CN 101743000 A, 2010.06.16

钟良坤, 等. 3-芳基异噁唑啉-吡啶-5-甲酰胺类化合物的合成及杀虫活性研究.《有机化学》.2019, 第39卷

Yong-Kang Zhang, 等. Optimization of isoxazoline amide benzoxaboroles for identification of a development candidate as an oral long acting animal ectoparasiticide.《Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters》.2016, 第26卷 (第13期), 3182-3186.

审查员 刘冬

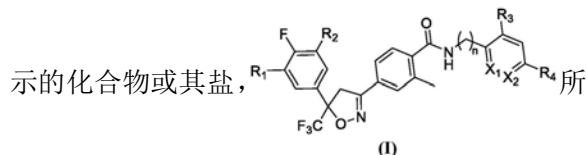
权利要求书2页 说明书26页

(54) 发明名称

一种异噁唑啉取代的苯甲酰胺类衍生物及其制备方法与用途

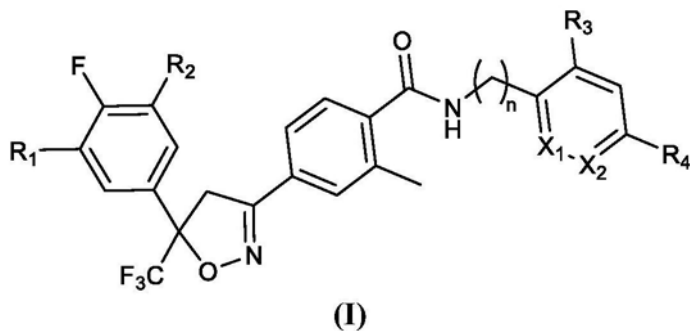
(57) 摘要

本发明属于杀虫、杀螨剂技术领域, 具体涉及一种异噁唑啉取代的苯甲酰胺类衍生物及其制备方法与用途。本发明具体提供如下式 (I) 所示的化合物或其盐,



述式 (I) 所示的化合物对农业或其他领域中的多种害虫、害螨都表现出很好的活性。并且, 这些化合物在很低的剂量下就可以获得很好的防治效果, 因此可用于制备杀虫和/或杀螨剂, 具有较好的应用前景。

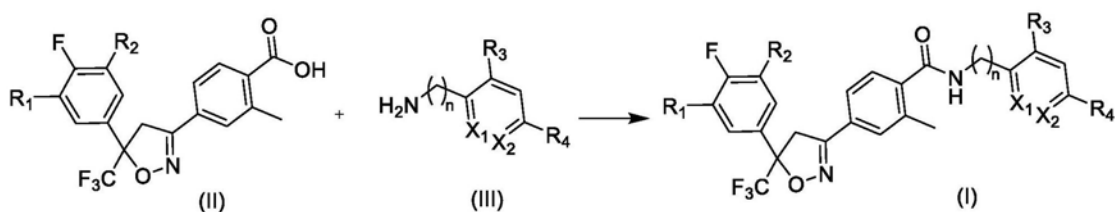
1. 式 (I) 所示的化合物或其药学上可接受的盐,



编号	X ₁	X ₂	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	n
1.	CH	N	Cl	Cl	H	Cl	1
2.	CH	N	F	F	H	Cl	1
3.	CH	N	Cl	Cl	CF ₃	H	1
4.	CH	N	F	F	CF ₃	H	1
5.	CH	N	Cl	Cl	CF ₃	Cl	1
6.	CH	N	F	F	CF ₃	Cl	1
7.	CH	N	Cl	Cl	Cl	Cl	1
8.	CH	N	F	F	Cl	Cl	1
9.	N	CH	Cl	Cl	Cl	CF ₃	1
10.	N	CH	F	F	Cl	CF ₃	1
11.	N	CH	Cl	Cl	Cl	Cl	1
12.	N	CH	F	F	Cl	Cl	1
13.	N	CH	Cl	Cl	Cl	H	1
14.	N	CH	F	F	Cl	H	1
15.	CH	N	Cl	Cl	H	Cl	2
16.	CH	N	F	F	H	Cl	2
17.	CH	N	Cl	Cl	CF ₃	H	2
18.	CH	N	F	F	CF ₃	H	2
19.	N	CH	Cl	Cl	Cl	CF ₃	2
20.	N	CH	F	F	Cl	CF ₃	2

2. 权利要求1所述化合物的制备方法, 包括如下步骤A) 或步骤B) :

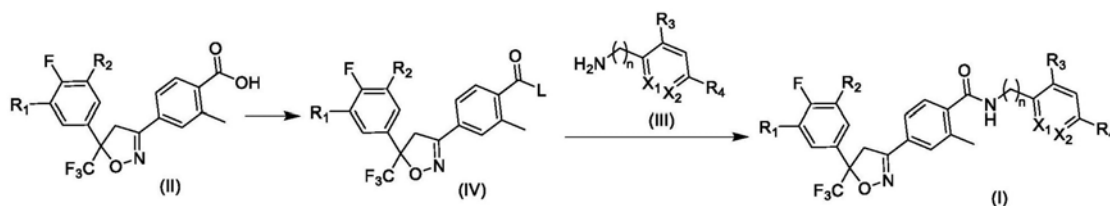
步骤A) : 式 (II) 化合物与式 (III) 化合物发生缩合反应得到式 (I) 化合物;



步骤B) :

B1) 式 (II) 化合物与卤化剂发生反应得到式 (IV) 化合物;

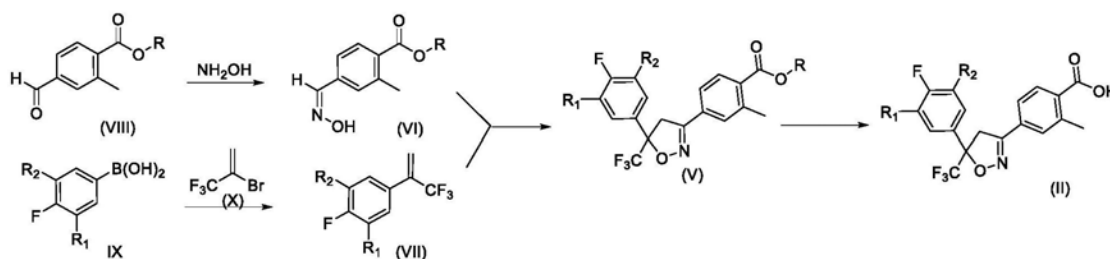
B2) 式 (IV) 化合物与式 (III) 化合物发生反应得到式 (I) 化合物;



其中 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 X_1 、 X_2 、 n 具有权利要求1所述的定义;L选自离去基团。

3. 根据权利要求2所述的制备方法,其特征在于,L选自Cl、Br、I或F。

4. 根据权利要求2所述的制备方法,其特征在于,所述式 (II) 化合物的制备方法包括如下步骤:



(1) 式 (VIII) 化合物与羟胺或盐酸羟胺反应得到式 (VI) 化合物;

(2) 式 (IX) 化合物与式 (X) 反应得到式 (VII) 化合物;

(3) 式 (VI) 化合物与式 (VII) 化合物反应得到式 (V) 化合物;

(4) 式 (V) 化合物水解得到式 (II) 化合物;

其中 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 X_1 、 X_2 、 n 具有权利要求1所述的定义;R为1-6个碳原子的烷基。

5. 根据权利要求4所述的制备方法,其特征在于,R为甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基。

6. 一种农药组合物,其特征在于,所述农药组合物包含作为活性成分的权利要求1所述式 (I) 所示的化合物或其药学上可接受的盐中的一种、两种或者更多种。

7. 根据权利要求6所述的农药组合物,其特征在于,所述农药组合物为杀虫和/或杀螨组合物。

8. 权利要求1所述式 (I) 所示的化合物或其药学上可接受的盐中的一种、两种或者更多种在制备农药中的用途。

9. 根据权利要求8所述的用途,其特征在于,所述农药为杀虫剂和/或杀螨剂。

10. 一种防治植物中害虫和/或害螨的方法,其特征在于,所述方法包括将权利要求1所述有效量的式 (I) 所示的化合物或其药学上可接受的盐中的一种、两种或者更多种,或将权利要求6所述组合物施于害虫和/或害螨的生长介质上。

一种异噁唑啉取代的苯甲酰胺类衍生物及其制备方法与用途

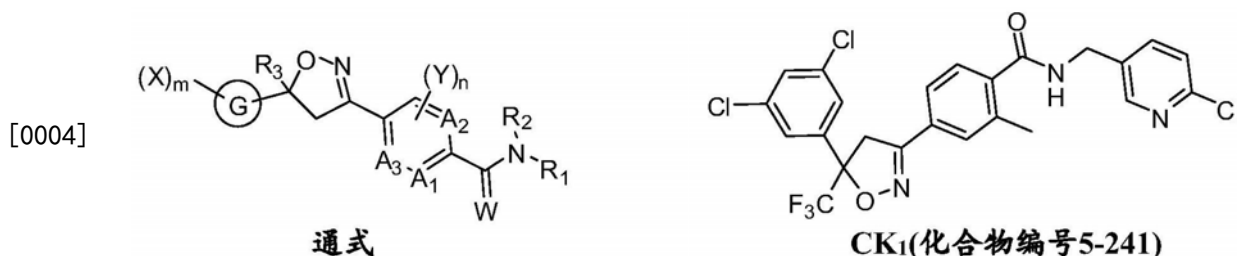
技术领域

[0001] 本发明属于杀虫、杀螨剂技术领域，具体涉及一种异噁唑啉取代的苯甲酰胺类衍生物及其制备方法与用途。

背景技术

[0002] 杀虫、杀螨剂为农业增产解决人类粮食问题发挥了极为重要的作用。随着对化学物质的安全性及对环境的影响的要求日益提高，期望开发出更安全的有害生物防除剂。而且由于常年使用杀虫剂和杀螨剂等有害生物防除剂，有害生物对这些生物防除剂逐渐产生了抗性，导致防治效果不理想。因此，开发安全性、防除效果、残留效应等性能优异的有害生物防除剂是未来的发展趋势。

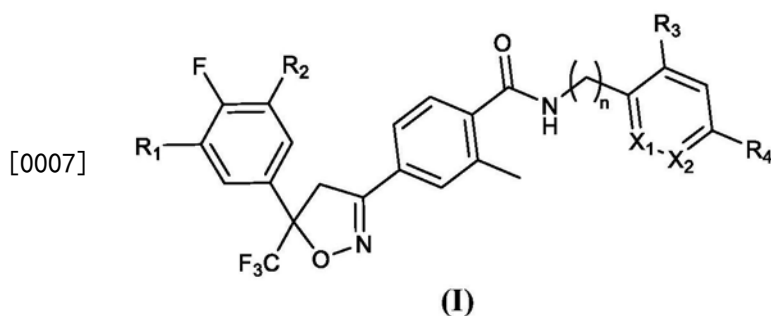
[0003] 专利文献W02005085216公开了如下所示异噁唑啉类化合物CK₁ (化合物编号5-241)：



[0005] 然而，上述化合物的生物活性仍有待进一步改善。为发现性能更加优异的杀虫、杀螨剂，发明人进行了深入研究。

发明内容

[0006] 为改善上述问题，本发明提供下式 (I) 所示的化合物、其立体异构体、消旋体、互变异构体、氮氧化物、或其药学上可接受的盐，



[0008] R₁、R₂相同或不同，彼此独立地选自F或Cl；

[0009] R₃、R₄相同或不同，彼此独立地选自H、Cl或CF₃，且R₃、R₄不同时为H；

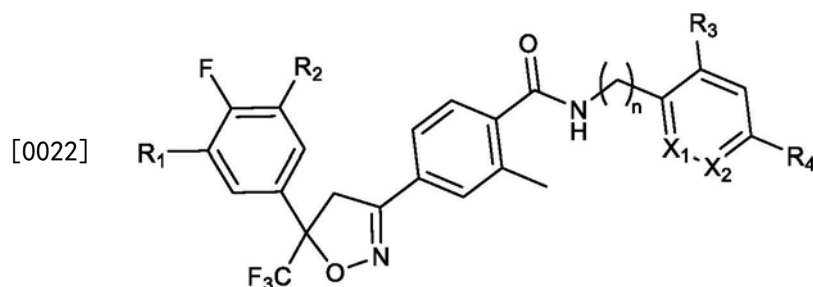
[0010] X₁、X₂彼此独立地选自CH或N，且X₁与X₂不同时为CH或N；

[0011] n选自1或2；

[0012] 根据本发明的实施方案：式 (I) 中，

[0013] X₁为CH，X₂为N；

- [0014] R_1 、 R_2 相同或不同,彼此独立地选自F或Cl;
 [0015] R_3 、 R_4 相同或不同,彼此独立地选自H、Cl或 CF_3 ,且 R_3 、 R_4 不同时为H;
 [0016] n选自1或2。
 [0017] 根据本发明的实施方案:式(I)中,
 [0018] X_1 为N, X_2 为CH;
 [0019] R_1 、 R_2 相同或不同,彼此独立地选自F或Cl;
 [0020] R_3 、 R_4 相同或不同,彼此独立地选自Cl或 CF_3 ,且 R_3 、 R_4 不同时为H; n选自1或2。
 [0021] 作为实例,所述式(I)化合物选自如下化合物,

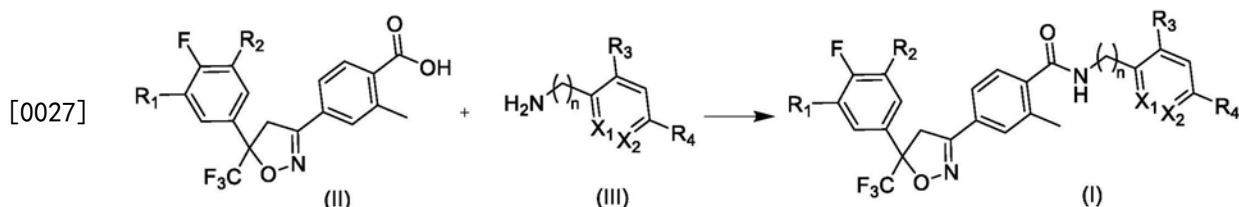


[0023] 表1

[0024]

编号	X_1	X_2	R_1	R_2	R_3	R_4	n
1.	CH	N	Cl	Cl	H	Cl	1
2.	CH	N	F	F	H	Cl	1
3.	CH	N	Cl	Cl	CF_3	H	1
4.	CH	N	F	F	CF_3	H	1
5.	CH	N	Cl	Cl	CF_3	Cl	1
6.	CH	N	F	F	CF_3	Cl	1
7.	CH	N	Cl	Cl	Cl	Cl	1
8.	CH	N	F	F	Cl	Cl	1
9.	N	CH	Cl	Cl	Cl	CF_3	1
10.	N	CH	F	F	Cl	CF_3	1
11.	N	CH	Cl	Cl	Cl	Cl	1
12.	N	CH	F	F	Cl	Cl	1
13.	N	CH	Cl	Cl	Cl	H	1
14.	N	CH	F	F	Cl	H	1
15.	CH	N	Cl	Cl	H	Cl	2
16.	CH	N	F	F	H	Cl	2
17.	CH	N	Cl	Cl	CF_3	H	2
18.	CH	N	F	F	CF_3	H	2
19.	N	CH	Cl	Cl	Cl	CF_3	2
20.	N	CH	F	F	Cl	CF_3	2

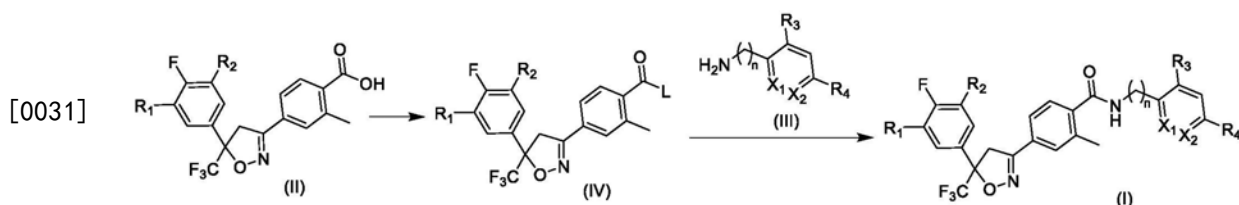
- [0025] 本发明还提供如上式(I)所示化合物的制备方法,包括如下步骤A)或步骤B):
 [0026] 步骤A):式(II)化合物与式(III)化合物发生缩合反应得到式(I)化合物;



[0028] 步骤B) :

[0029] B1) 式 (II) 化合物与卤化剂发生反应得到式 (IV) 化合物;

[0030] B2) 式 (IV) 化合物与式 (III) 化合物发生反应得到式 (I) 化合物;



[0032] 其中 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 X_1 、 X_2 、 n 具有如上所述的定义;L选自离去基团,例如Cl、Br、I或F。

[0033] 式 (III) 所示的胺可以参考W02009080250中记载的方法制备,或者可以采用本领域技术人员所知的方法制备。

[0034] 根据本发明的实施方案,步骤A)中所述反应可以在缩合剂存在下进行,所述缩合剂选自N,N'-二环己基碳二亚胺(DCC)、N,N'-二异丙基碳二亚胺(DIC)、1-羟基苯并三唑(HOBT)、2-(7-氮杂苯并三氮唑)-N,N,N',N'-四甲基脒六氟磷酸酯(HATU)、六氟磷酸苯并三唑-1-基-氧基三吡咯烷基磷(PyBOP)中的至少一种;

[0035] 根据本发明的实施方案,步骤A)中所述反应可以在碱存在下进行,所述碱可以为无机碱,例如选自吡啶、三乙胺、4-(二甲氨基)吡啶(DMAP)、二异丙基乙胺(DIEA)中的至少一种;

[0036] 根据本发明的实施方案,步骤A)中所述反应在溶剂中进行,所述溶剂选自N,N-二甲基乙酰胺、N,N-二甲基甲酰胺、四氢呋喃、2-甲基四氢呋喃、二氧六环、乙腈、甲苯、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷中的至少一种;

[0037] 根据本发明的实施方案,步骤A)中所述反应温度为所述反应的温度可以为-5~120℃,例如0~50℃,如15~30℃。

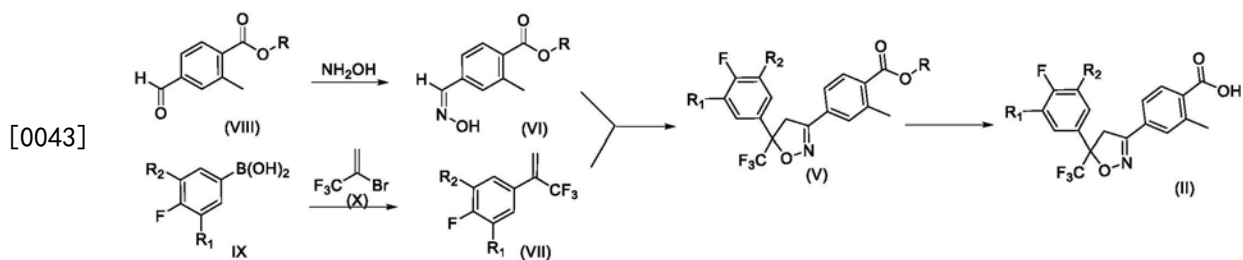
[0038] 根据本发明的实施方案,步骤B1)中所述卤化剂选自亚硫酸氯、草酰氯或二氯亚砷;

[0039] 根据本发明的实施方案,步骤B1)中所述反应的温度可以为0~100℃,例如0~50℃,如0~30℃;

[0040] 根据本发明的实施方案,步骤B2)中所述反应可以在碱的存在下进行,所述碱可选自有机碱或无机碱,如吡啶、三乙胺、4-(二甲氨基)吡啶(DMAP)、二异丙基乙胺(DIEA)、碳酸钠、碳酸钾、氢氧化钠、氢氧化钾、叔丁醇钾或氢化钠中的一种、两种或者更多种。优选的溶剂可为N,N-二甲基乙酰胺、N,N-二甲基甲酰胺、二氧六环、甲苯、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷;

[0041] 根据本发明的实施方案,步骤B2)中所述反应的温度可以为0~120℃,例如0~50℃,如15~30℃。

[0042] 根据本发明的实施方案,式(II)所示化合物的制备方法包括以下步骤:



[0044] (1) 式(VIII)化合物与羟胺或盐酸羟胺反应得到式(VI)化合物;

[0045] (2) 式(IX)化合物与式(X)反应得到式(VII)化合物;

[0046] (3) 式(VI)化合物与式(VII)化合物反应得到式(V)化合物;

[0047] (4) 式(V)化合物水解得到式(II)化合物;

[0048] 其中 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 X_1 、 X_2 、 n 具有如上所述的定义; R 为1-6个碳原子的烷基,例如甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基;

[0049] 根据本发明的实施方案,步骤(1)可以在碱存在下进行,所述碱选自有机碱,如三乙胺、乙酸钠,或无机碱如碳酸氢钠;所述反应溶剂选自甲醇、乙醇等醇类溶剂或水或它们的混合物;所述反应的温度可以为 $0\sim 100^\circ\text{C}$,优选 $15\sim 30^\circ\text{C}$ 。

[0050] 根据本发明的实施方案,步骤(2)可以在催化剂存在下进行,所述催化剂选自四(三苯基膦)钯、乙酸钯或双(三苯基膦)二氯化钯;

[0051] 根据本发明的实施方案,步骤(2)可以在碱存在下进行,所述碱选自碳酸钠、碳酸钾、吡啶、三乙胺或4-(二甲氨基)吡啶;所述在溶剂选自甲苯、四氢呋喃、 N,N -二甲基甲酰胺或水;所述反应的温度可以为 $30\sim 150^\circ\text{C}$,例如 $50\sim 120^\circ\text{C}$ 。

[0052] 根据本发明的实施方案,步骤(3)可以在卤化剂的存在下进行,所述卤化剂可以为 N -氯代琥珀酰亚胺(NCS)、 N -溴代琥珀酰亚胺(NBS);所述反应的温度可以为 $0\sim 100^\circ\text{C}$,例如 $15\sim 30^\circ\text{C}$;

[0053] 根据本发明的实施方案,步骤(3)可以在碱存在下进行,所述碱选自三乙胺、吡啶、碳酸氢钠、碳酸钠中的至少一种;所述反应的温度可以为 $0\sim 100^\circ\text{C}$,例如 $15\sim 30^\circ\text{C}$ 。

[0054] 根据本发明的实施方案,步骤(4)可以在碱存在下进行,所述碱选自氢氧化钠、氢氧化钾或氢氧化锂中的至少一种;或者在二氯甲烷中用酸如三氟乙酸处理;

[0055] 根据本发明的实施方案,步骤(4)所述反应的温度可以为 $0\sim 150^\circ\text{C}$,例如 $15\sim 80^\circ\text{C}$ 。

[0056] 式(VIII)所示的醛可以作为商品购买或用本领域技术人员所知方法制备。

[0057] 式(IX)所示的硼酸与式(X)所示的乙烯基化合物可作为商品购买获得或用本领域技术人员所知方法制备。

[0058] 根据本发明的实施方案,所述反应可参考专利文献W02009080250中记载的方法进行。

[0059] 本文中式(I)化合物及其原料的制备可根据各情况下适合的反应条件和原料的选择,可以例如在一步反应中用根据本发明的另一取代基仅替换一个取代基,或可在相同反应步骤中用根据本发明的其他取代基替换多个取代基。

[0060] 如果各化合物不可经由上述路线得到,则它们可通过衍生其他化合物或通过将所

述合成路线常规变化而制备。

[0061] 反应完成后可以将反应混合物以常规方式后处理,如通过与水混合、分离相以及合适的话通过色谱法例如在氧化铝或硅胶上提纯粗产物。

[0062] 本发明式(I)化合物药学上可接受的盐,其可以通过已知的方法来制备。例如通过适宜的酸处理得到式(I)化合物的酸加成盐。其制备方法如下:将式(I)化合物与酸如盐酸、硫酸、磷酸、乙酸、三氟乙酸、苹果酸或柠檬酸等在水、乙醚或甲苯等溶剂中反应,可以很方便地得到式(I)化合物药学上可接受的盐。

[0063] 以上制备方法可以获得式(I)化合物的异构体混合物,如需得到纯异构体,可采用常规方法如结晶或色谱法进行分离。

[0064] 除非另外指明,上述所有反应可便利地在大气压力下或具体反应的自身压力下进行。

[0065] 本发明还提供一种农药组合物,例如杀虫和/或杀螨组合物,其包含作为活性成分的式(I)所示的化合物、其立体异构体、消旋体、互变异构体、氮氧化物或其药学上可接受的盐中的一种、两种或者更多种。

[0066] 根据本发明的实施方案,所述组合物中活性成分的重量百分含量为0.1-99.9%,例如为0.5-99%。

[0067] 根据本发明的实施方案,所述组合物中还包括农业和/或林业和/或卫生上可接受的载体中的一种、两种或者更多种。

[0068] 根据本发明的实施方案,所述组合物可以以制剂的形式施用。

[0069] 例如,式(I)所示化合物作为活性成分溶解或分散于载体中或配制成制剂以便作为杀虫和/或杀螨使用时更易于分散。

[0070] 根据本发明的实施方案,所述制剂包括但不限于如下形式:可湿性粉剂、油悬剂、水悬剂、水乳剂、水剂、乳油或微胶囊等。

[0071] 根据发明的实施方案,所述组合物中还可以加入一种液体或固体载体,及任选地表面活性剂。

[0072] 本发明还提供式(I)所示的化合物、其立体异构体、消旋体、互变异构体、氮氧化物或其药学上可接受的盐中的一种、两种或者更多种作为农药,例如杀虫剂和/或杀螨剂的用途。

[0073] 本发明还提供式(I)所示的化合物、其立体异构体、消旋体、互变异构体、氮氧化物或其药学上可接受的盐中的一种、两种或者更多种在制备农药,例如杀虫剂和/或杀螨剂中的用途。

[0074] 本发明还提供一种防治害虫和/或害螨的方法,包括将有效量的式(I)所示的化合物、其立体异构体、消旋体、互变异构体、氮氧化物或其药学上可接受的盐中的一种、两种或者更多种,或将所述组合物施于害虫和/或害螨的生长介质上。

[0075] 根据本发明的实施方案,所述有效量为每公顷10克到1000克,优选有效量为每公顷20克到500克。

[0076] 根据本发明的活性物质或根据本发明要使用的活性物质鉴于良好的植物耐受性、有利的恒温动物毒性和良好的环境相容性,适于保护植物和植物器官、增加采收产率、提高采收物的品质和防治有害动物,特别是在农业、园艺业、畜牧业、林业、花园以及休闲设施

中、仓库虫害保护及材料保护中、以及卫生领域中出现的害虫、螨虫等。它们优选可用作植物保护组合物。它们对常规的敏感和抗性物种以及对所有或单独的发育阶段具有活性。上述害虫、螨虫包括但不限于：

[0077] 节肢动物门 (Arthropoda)，尤其是蛛形纲 (Arachnida)，例如，粉螨属 (*Acarus* spp.)、柑橘瘤瘿螨 (*Aceria sheldoni*)、刺皮节痹属 (*Aculops* spp.)、刺瘿螨属 (*Aculus* spp.)、钝眼痹属 (*Amblyomma* spp.)、山楂叶螨 (*Amphitetranychus viennensis*)、锐缘痹属 (*Argas* spp.)、牛痹属 (*Boophilus* spp.)、短须螨属 (*Brevipalpus* spp.)、*Bryobiagraminum*、苜蓿苔螨 (*Bryobia praetiosa*)、刺尾蝎属 (*Centruroides* spp.)、皮螨属 (*Choriotptes* spp.)、鸡皮刺螨 (*Dermanyssus gallinae*)、屋尘螨 (*Dermatophagoides pteronyssinus*)、粉尘螨 (*Dermatophagoides farinae*)、革痹属 (*Dermacentor* spp.)、始叶螨属 (*Eotetranychus* spp.)、梨上瘿螨 (*Epitrimerus pyri*)、真叶螨属 (*Eutetranychus* spp.)、瘿螨属 (*Eriophyes* spp.)、*Glycyphagus domesticus*、红足海镰螯螨 (*Halotydeus destructor*)、半跗线螨属 (*Hemitarsonemus* spp.)、璃眼痹属 (*Hyalomma* spp.)、硬痹属 (*Ixodes* spp.)、毒蛛属 (*Latrodectus* spp.)、斜蛛属 (*Loxosceles* spp.)、瘤叶螨属 (*Metatetranychus* spp.)、*Neutrombicula autumnalis*、*Nuphessa* spp.、小爪螨属 (*Oligonychus* spp.)、钝缘痹属 (*Ornithodoros* spp.)、禽刺螨属 (*Ornithonyssus* spp.)、全爪螨属 (*Panonychus* spp.)、桔皱叶刺瘿螨 (*Phyllocoptruta oleivora*)、侧多食跗线螨 (*Polyphagotarsonemus latus*)、痒螨属 (*Psoroptes* spp.)、扇头痹属 (*Rhipicephalus* spp.)、根螨属 (*Rhizoglyphus* spp.)、疥螨属 (*Sarcoptes* spp.)、中东金蝎 (*Scorpiomaurus*)、*Steneotarsonemus* spp.、*Steneotarsonemus pinki*、跗线螨属 (*Tarsonemus* spp.)、叶螨属 (*Tetranychus* spp.)、阿氏真恙螨 (*Trombicula alfreddugesi*)、*Vaejovis* spp.、背瘤瘿螨 (*Vasates lycopersici*)；

[0078] 鞘翅目 (Coleoptera) (甲虫)：豆象属种 (*Acanthoscelides* spp.) (象虫)、菜豆象 (*Acanthoscelides obtectus*) (普通豌豆象)、白蜡窄吉丁 (*Agrilus planipennis*) (花曲柳窄吉丁)、金针虫属种 (*Agriotes* spp.) (金针虫)、光肩星天牛 (*Anoplophora glabripennis*) (亚洲长角天牛)、棉铃象属种 (*Anthonomus* spp.) (象甲科)、墨西哥棉铃象 (*Anthonomus grandis*) (棉铃虫)、茧蜂属种 (*Aphidius* spp.)、象甲属种 (*Apion* spp.) (象虫)、甘蔗金龟属种 (*Apogonia* spp.) (蛱螬)、黑绒金龟 (*Atacnius sprctulus*) (黑绒金龟子)、甜菜隐食甲 (*Atomaria linearis*) (小甜菜甲虫 (pygmy mangold beetle))、守瓜属种 (*Aulacophore* spp.)、甜菜象 (*Bothynoderes punctiventris*) (甜菜根象虫)、豆象属种 (*Bruchus* spp.) (象虫)、豌豆象 (*Bruchus pisorum*) (豌豆象虫)、*Cacoesia* 属种 (*Cacoesia* spp.)、四纹豆象 (*Callosobruchus maculatus*) (南方豇豆象虫)、黄斑露尾甲 (*Carpophilus hemipteras*) (干果甲虫)、甜菜龟甲 (*Cassida vittata*)、天牛属种 (*Cicrosterna* spp.)、*Cicrotoma* 属种 (*Cicrotoma* spp.) (金滴虫 (chrysomcids))、豆叶甲 (*Cerotoma trifurcata*) (豆叶甲虫)、龟象属种 (*Ceutorhynchus* spp.) (象虫)、白菜籽龟象 (*Ceutorhynchus assimilis*) (白菜象鼻虫 (cabbage seedpod weevil))、芜菁龟象 (*Ceutorhynchus napi*) (卷心菜象虫 (cabbage curculio))、跳甲属 (*Chaetocnema* spp.) (金滴虫)、*Colaspis* 属种 (*Colaspis* spp.) (土甲虫)、*Conoderus scalaris*、*Conoderus stigmosus*、李象 (*Conotrachelus nenuphar*) 梅锥象甲)、*Cotinus nitidis* (绿花金龟

(Green Junebeetle))、石刁柏负泥虫(*Crioceris asparagi*) (石刁柏甲虫)、锈赤扁谷盗(*Cryptolestes ferrugineus*) (锈谷甲虫(rusty grainbeetle))、长角扁谷盗(*Cryptolestes pusillus*) (扁谷盗)、土耳其扁谷盗(*Cryptolestes turcicus*) (土耳其谷甲虫(Turkish grainbeetle))、*Ctenicera* 属种(*Ctenicera* spp.) (线虫)、象虫属种(*Curculio* spp.) (象虫)、圆头犀金龟属种(*Cyclocephala* spp.) (蛴螬)、密点细枝象(*Cylindroctonus adspersus*) (向日葵草象虫(sunflower stem weevil))、芒果剪叶象(*Deporaus marginatus*) (芒果剪叶象虫(mango leaf-cutting weevil))、火腿皮蠹(*Dermestes lardarius*) (火腿皮蠹)、白腹皮蠹(*Dermestes maculatus*) (白腹皮蠹)、叶甲属种(*Diabrotica* spp.) (叶甲)、墨西哥豆瓢虫(*Epilachna varivestis*) (墨西哥豆甲虫)、蛀茎象甲(*raustinus cubae*)、苍白根颈象(*Hylobius pales*) (好斗象甲(pales weevil))、叶象属种(*Hypera* spp.) (象虫)、紫苜蓿叶象(*Hypera postica*) (紫苜蓿象鼻虫)、*Hyperodes*属种(*Hyperodes* spp.) (阿根廷茎象甲(*Hyperodes* weevil))、咖啡果小蠹(*Hypothenemus hampei*) (咖啡果甲虫)、齿小蠹属种(*Ips* spp.) (棘胫小蠹(engravers))、烟草甲(*Lasioderma serricornis*) (烟草甲虫)、马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata*) (科罗拉多马铃薯甲虫)、*Liogenys fuscus*、*Liogenys suturalis*、稻水象甲(*Lissorhoptrus oryzophilus*) (稻水象甲)、粉蠹属种(*Lyctus* spp.) (木蠹蛾/粉蠹甲虫(powder post beetles))、*Maecolaspis joliveti*、*Megascelis*属种(*Megascelis* spp.)、玉米叩甲(*Melanotus communis*)、露尾甲属种(*Meligethes* spp.)、油菜露尾甲(*Meligethes aeneus*) (花金龟(blossom beetle))、五月金龟子(*Melolontha melolontha*) (普通欧洲金龟子)、*Oberea brevis*、线形筒天牛(*Oberea linearis*)、椰蛀犀金龟(*Oryctes rhinoceros*) (椰枣甲虫(date palm beetle))、贸易锯谷盗(*Oryzaephilus mercator*) (市场锯谷盗(merchant grain beetle))、锯谷盗(*Oryzaephilus surinamensis*) (锯齿谷甲虫(sawtoothed grain beetle))、喙象甲属种(*Otiorhynchus* spp.) (象虫)、黑角负泥虫(*Oulema melanopus*) (橙足负泥虫(cereal leaf beetle))、水稻负泥虫(*Oulema oryzae*)、玫瑰短喙象属种(*Pantomorus* spp.) (象虫)、食叶鳃金龟属种(*Phyllophaga* spp.) (五月/六月金龟子)、*Phyllophaga cuyabana*、黄条跳甲属种(*Phyllotreta* spp.) (金滴虫)、苹虎象属种(*Phynchites* spp.)、日本弧丽金龟(*Popillia japonica*) (日本金龟子)、大谷蠹(*Prostephanus truncatus*) (大谷长蠹(larger grain borer))、谷蠹(*Rhizopertha dominica*) (谷小蛀虫(lesser grain borer))、根鳃金龟属种(*Rhizotrogus* spp.) (欧洲金龟子(European chafer))、隐喙象属种(*Rhynchophorus* spp.) (象虫)、小蠹属种(*Scolytus* spp.) (木蠹蛾)、*Shenophorus*属种(*Shenophorus* spp.) (谷象)、豌豆叶象(*Sitona lineatus*) (豌豆叶象甲(pea leaf weevil))、米象属种(*Sitophilus* spp.) (谷象甲)、谷象(*Sitophilus granarius*) (谷虫(granary weevil))、米象(*Sitophilus oryzae*) (米象甲(rice weevil))、药材谷盗(*Stegobium paniceum*) (药材甲(drugstore beetle))、拟谷盗属种(*Tribolium* spp.) (面象虫)、赤拟谷盗(*Tribolium castaneum*) (赤拟谷盗(red flour beetle))、杂拟谷盗(*Tribolium confusum*) (杂拟谷盗(confused flour beetle))、花斑皮蠹(*Trogoderma variabile*) (仓库皮蠹(warehouse beetle))和*Zabrus tenebrioides*。

[0079] 革翅目(Dermaptera) (蠼螋)。

[0080] 脉翅目 (Dictyoptera) (蟑螂): 德国小蠊 (*Blattella germanica*) (德国小蠊 (German cockroach))、东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*) (东方蠊)、宾夕法尼亚木蠊 (*Parcoblatta pennylvanica*)、美洲大蠊 (*Periplaneta americana*) (美洲蜚蠊 (Americancockroach))、澳洲大蠊 (*Periplaneta australoasiae*) (澳洲大蠊 (Australia ncockroach))、褐色大蠊 (*Pcriplancta brunna*) (褐色大蠊 (brown cockroach))、烟色大蠊 (*Periplaneta fuliginosa*) (黑胸大蠊 (smokybrown cockroach))、蔗绿蜚蠊 (*Pyncoselussuninamensis*) (蔗蠊 (Surinam cockroach)) 和长须蜚蠊 (*Supella longipalpa*) (褐带蜚蠊 (brownbanded cockroach))。

[0081] 双翅目 (Diptera) (苍蝇): 伊蚊属种 (*Aedes* spp.) (蚊)、紫苜蓿潜蝇 (*Agromyza frontella*) (紫苜蓿潜蝇 (alfalfa blotch leafminer))、潜蝇属种 (*Agromyza* spp.) (潜叶蝇)、按实蝇属种 (*Anastrepha* spp.) (果蝇)、加勒比按实蝇 (*Anastrepha suspensa*) (加勒比按实蝇 (Caribbean fruit fly))、疟蚊属种 (*Anopheles* spp.) (蚊)、果实蝇属种 (*Batrocera* spp.) (果蝇)、瓜实蝇 (*Bactrocera cucurbitae*) (瓜蝇)、桔小实蝇 (*Bactrocera dorsalis*) (桔实蝇)、小条实蝇属种 (*Ceratitis* spp.) (果蝇)、地中海小条实蝇 (*Ceratitis capitata*) (地中海果蝇)、斑虻属种 (*Chrysops* spp.) (鹿虻)、锥蝇属种 (*Cochliomyia* spp.) (旋丽蝇幼虫)、虻蚊属种 (*Contarinia* spp.) (虻蚊)、库蚊属种 (*Culex* spp.) (蚊)、叶虻蚊属种 (*Dasineura* spp.) (虻蚊)、油菜叶虻蚊 (*Dasineura brassicae*) (卷心菜虻蚊)、地种蝇属种 (*Delia* spp.)、灰地种蝇 (*Delia platura*) (根蛆 (seed cornmaggot))、果蝇属种 (*Drosophila* spp.) (醋蝇)、厕蝇属种 (*Fannia* spp.) (家蝇)、黄腹厕蝇 (*Fannia canicularis*) (夏厕蝇 (little house fly))、灰腹厕蝇 (*Fannia scalaris*) (灰腹厕蝇)、大马胃蝇 (*Gasterophilus intestinalis*) (马胃蝇)、*Gracillia perseae*、扰血蝇 (*Haematobia irritans*) (角蝇)、黑蝇属种 (*Hylemyia* spp.) (根蛆 (root maggot))、纹皮蝇 (*Hypoderma lineatum*) (普通纹皮蝇 (common cattle grub))、斑潜蝇属种 (*Liriomyza* spp.) (潜叶蝇)、甘蓝斑潜蝇 (*Liriomyza brassica*) (蛇行潜叶蝇 (serpentine leafminer))、绵羊虱蝇 (*Melophagus ovinus*) (绵羊虻)、蝇属种 (*Musca* spp.) (家蝇 (muscid fly))、秋家蝇 (*Musca autumnalis*) (秋家蝇 (face fly))、家蝇 (*Vuscadomestica*) (家蝇 (house fly))、羊狂蝇 (*Oestrusovis*) (羊鼻蝇 (sheep bot fly))、欧洲麦秆蝇 (*Oscinella frit*) (瑞典麦秆蝇)、甜菜泉蝇 (*Pegomyia betae*) (菠菜潜叶蝇 (beetle afminer))、麦蝇属种 (*Phorbia* spp.)、胡萝卜茎蝇 (*Psila rosae*) (胡萝卜锈蝇 (carrot rust fly))、樱桃果蝇 (*Rhagoletis cerasi*) (樱桃果蝇 (cherry fruit fly))、苹果果实蝇 (*Rhagoletis pomonella*) (苹果蛆 (apple maggot))、麦红吸浆虫 (*Sitodiplosis osellana*) (橙色小麦花蚊 (orange wheat blossom midge))、厩螫蝇 (*Stomoxys calcitrans*) (厩螫蝇 (stable fly))、牛虻属种 (*Taenias* spp.) (马蝇) 和大蚊属种 (*Tipula* spp.) (大蚊)。

[0082] 半翅目 (Hemiptera) (蝽): 拟绿蝽 (*Acrosternum hilare*) (绿蝽 (green stink bug))、美洲谷长蝽 (*Blissus leucopterus*) (长蝽 (chinch bug))、马铃薯盲蝽 (*Calocoris norvegicus*) (马铃薯盲蝽 (potato mirid))、热带臭虫 (*Cimex hemipterus*) (热带臭虫 (tropical bed bug))、臭虫 (*Cimex lectularius*) (臭虫 (bed bug))、*Dagbertus fasciatus*、*Dichelops furcatus*、棉黑翅红蝽 (*Dysdercus suturellus*) (棉红蝽

(cottonstainer))、*Edessa meditabunda*、欧扁盾蝽 (*Eurygaster maura*) (谷虫 (cereal bug))、*Euschistus heros*、褐臭蝽 (*Euschistus servus*) (褐蝽 (brown stink bug))、安氏角盲蝽 (*Helopeltis antonii*)、茶角盲蝽 (*Helopeltis theivora*) (tea blight plantbug)、蝽属种 (*Lagynotomus* spp.) (蝽)、大稻缘蝽 (*Leptocoris oratorius*)、异稻缘蝽 (*Leptocoris varicornis*)、草盲蝽属种 (*Lygus* spp.) (盲蝽 (plant bug))、豆荚草盲蝽 (*Lygushesperus*) (western tarnished plant bug)、木槿曼粉蝽 (*Maconellicoccus hirsutus*)、*Neurocolpus longirostris*、稻绿蝽 (*Nezara viridula*) (southern green stink bug)、植盲蝽属种 (*Phyllocoris* spp.) (盲蝽)、加利福尼亚植盲蝽 (*Phytocoris californicus*)、*Phytocoris relativus*、*Piezodorus guildingi*、四线盲蝽 (*Poecilopsus lineatus*) (fourlined plant bug)、*Psallus vaccinicola*、*Pseudacysta perseae*、*Scaptocoris castanea* 和锥蝽属种 (*Triatoma* spp.) (吸血锥鼻虫 (bloodsuckingconenose bug)/猎蝽 (kissing bug))。

[0083] 同翅目 (Homoptera) (蚜虫、蚧、粉虱、叶蝉)：豌豆蚜 (*Acyrthosiphon pisum*) (豌豆蚜 (pea aphid))、球蚜属种 (*Adelges* spp.) (adelgids)、甘蓝粉虱 (*Aleurodes proletella*) (卷心菜粉虱)、螺旋粉虱 (*Aleurodicus disperses*)、丝绒粉虱 (*Aleurothrixus flaccosus*) (棉粉虱 (woolly whitefly))、白轮盾蚧属种 (*Aluacaspis* spp.)、*Amrasca bigutella bigutella*、沫蝉属种 (*Aphrophora* spp.) (叶蝉 (leafhopper))、红圆蚧 (*Aonidiella aurantii*) (加利福尼亚红蚧 (California redscale))、蚜虫属种 (*Aphis* spp.) (蚜虫)、棉蚜 (*Aphis gossypii*) (cotton aphid)、苹果蚜 (*Aphis pomi*) (apple aphid)、茄无网蚜 (*Aulacorthum solani*) (毛地黄蚜 (foxgloveaphid))、粉虱属种 (*Bemisia* spp.) (粉虱)、银叶粉虱 (*Bemisia argentifolii*)、甘薯粉虱 (*Bemisia tabaci*) (sweetpotato whitefly)、烟粉虱 (*Bemisia tabaci* (Gennadius))、麦双尾蚜 (*Brachycolus noxius*) (俄罗斯蚜 (Russian aphid))、石刁柏小管蚜 (*Brachycorynclia asparagi*) (石刁柏蚜 (asparagusaphid))、*Brevinnia rehi*、甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*) (卷心菜蚜)、蜡蚧属种 (*Ceroplastes* spp.) (蚧)、红蜡蚧 (*Ceroplastes rubens*) (red wax scale)、雪盾蚧属种 (*Chionaspis* spp.) (蚧)、圆盾蚧属种 (*Chrysomphalus* spp.) (蚧)、软蜡蚧属种 (*Coccusspp.*) (蚧)、苹粉红劣蚜 (*Dysaphis plantaginea*) (rosy apple aphid)、绿小叶蝉属种 (*Empoasca* spp.) (叶蝉)、苹果棉蚜 (*Eriosoma lanigerum*) (woolly apple aphid)、吹棉蚧 (*Icerya purchasi*) (cottony cushion scale)、芒果黄线叶蝉 (*Idioscopus nitidulus*) (mango leafhopper)、灰飞虱 (*Laodelphax striatellus*) (smaller brown planthopper)、蛎盾蚧属种 (*Lepidosaphes* spp.)、长管蚜属种 (*Macrosiphum* spp.)、大戟长管蚜 (*Macrosiphum euphorbiae*) (马铃薯蚜 (potato aphid))、麦长管蚜 (*Macrosiphum granarium*) (英国麦蚜 (English grain aphid))、蔷薇长管蚜 (*Macrosiphum rosae*) (蔷薇蚜 (rose aphid))、四线叶蝉 (*Macrosteles quadrilineatus*) (紫莞叶蝉 (aster leaf hopper))、*Mahanarva frimbiolata*、麦无网长管蚜 (*Metopolophium dirhodum*) (蔷薇麦蚜 (rose grain aphid))、*Midis longicornis*、桃蚜 (*Myzus persicae*) (桃蚜 (greenpeach aphid))、黑尾叶蝉属种 (*Nephotettix* spp.) (叶蝉)、黑尾叶蝉 (*Nephotettix cinctipes*) (绿叶蝉 (green leafhopper))、褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*) (brownplanthopper)、糠片盾蚧 (*Parlatoria*

pergandii) (chaff scale)、黑檀盾蚧 (Parlatoria aziziphi) (ebony scale)、玉米花翅飞虱 (Peregrinus maidis) (corn delphacid)、沫蝉属种 (Philaenus spp.) (吹沫虫)、葡萄根瘤蚜 (Phylloxera vitifoliae) (grape phylloxera)、去杉球蚧 (Physokermes piceae) (spruce bud scale)、臀纹粉蚧属种 (Planococcus spp.) (粉蚧)、粉蚧属种 (Pseudococcus spp.) (粉蚧)、菠萝洁粉蚧 (Pseudococcus brevipes) (pineapple mealy bug)、梨园盾蚧 (Quadraspidiotus perniciosus) (圣约瑟虫 (San Jose scale))、蚜蚧属种 (Rhopalosiphum spp.) (蚜虫) 玉米叶蚜 (Rhopalosiphum maidis) (玉米蚜 (corn leaf aphid))、禾谷缢管蚜 (Rhopalosiphum padi) (oatbird-cherry aphid)、珠蜡蚧属种 (Saissetia spp.) (蚧)、榄珠蜡蚧 (Saissetia oleae) (黑蚧)、麦二叉蚜 (Schizaphis graminum) (麦二叉蚜 (greenbug))、麦长管蚜 (Sitobion avenae) (英国麦蚜)、白背飞虱 (Sogatella furcifera) (white-backed planthopper)、彩斑蚜属种 (Therioaphis spp.) (蚜虫)、纹蜡蚧属种 (Toumeyella spp.) (蚧)、声蚜属种 (Toxoptera spp.) (蚜虫)、白粉虱属种 (Trialeurodes spp.) (粉虱)、温室白粉虱 (Trialeurodes vaporariorum) (温室粉虱 (greenhouse whitefly))、结翅白粉虱 (Trialeurodes abutiloneus) (banded wing whitefly)、尖盾蚧属种 (Unaspis spp.) (蚧)、矢尖蚧 (Unaspis yanonensis) (箭头蚧 (arrowhead scale)) 和 *Zulia entreriana*。

[0084] 膜翅目 (Hymenoptera) (蚂蚁、黄蜂和蜜蜂): 切叶蚁属种 (*Acromyrmex* spp.)、新疆菜叶蜂 (*Athalia rosae*)、叶蚁属种 (*Atta* spp.) (leafcutting ants)、黑蚁属种 (*Camponotus* spp.) (木蚁 (carpenter ant))、松叶蜂属种 (*Diprion* spp.) (叶蜂 (saw fly))、蚁属种 (*Formica* spp.) (蚂蚁)、阿根廷蚁 (*Iridomyrmex humilis*) (Argentine ant)、厨蚁属亚种 (*Monomorium* spp.)、小家蚁 (*Monomorium minimum*) (little black ant)、厨蚁 (*Monomorium pharaonis*) (法老蚁 (Pharaoh ant))、新松叶蜂属种 (*Neodiprion* spp.) (叶蜂)、收获蚁属种 (*Pogonomyrmex* spp.) (收获蚁)、马蜂属种 (*Polistes* spp.) (胡蜂 (paper wasp))、火蚁属种 (*Solenopsis* spp.) (火蚁)、香家蚁 (*Tapinoma sessile*) (香家蚁 (odorous house ant))、铺道蚁属种 (*Tetranomium* spp.) (铺道蚁 (pavement ant))、黄胡蜂属种 (*Vespa* spp.) (小黄蜂 (yellow jacket)) 和木蜂属种 (*Xylocopa* spp.) (木蜂 (carpenter bee))。

[0085] 等翅目 (Isoptera) (白蚁): 乳白蚁属种 (*Coptotermes* spp.)、曲颚白蚁 (*Coptotermes curvignathus*)、法国白蚁 (*Coptotermes frenchii*)、家白蚁 (*Coptotermes formosanus*) (Formosan subterranean termite)、角白蚁属种 (*Cornitermes* spp.) (长鼻白蚁 (nasute termite))、砂白蚁属种 (*Cryptotermes* spp.) (干木白蚁)、异白蚁属种 (*Heterotermes* spp.) (沙漠土栖白蚁 (desert subterranean termite))、金黄异白蚁 (*Heterotermes aureus*)、木白蚁属种 (*Kaloterme* spp.) (干木白蚁)、楹白蚁属种 (*Incisitermes* spp.) (干木白蚁)、大白蚁属种 (*Macrotermes* spp.) (培菌白蚁 (fungus growing termite))、缘木白蚁属种 (*Marginitermes* spp.) (干木白蚁)、锯白蚁属种 (*Microcerotermes* spp.) (草白蚁 (harvester termite))、稻麦小白蚁 (*Microtermes obesi*)、原角白蚁属种 (*Procornitermes* spp.)、散白蚁属种 (*Reticulitermes* spp.) (土栖白蚁)、*Reticulitermes banyulensis*、草地散白蚁 (*Reticulitermes grassei*)、黄肢散白蚁 (*Reticulitermes flavipes*) (东方土栖白

蚁)、美小黄散白蚁(*Reticulitermes hageni*)、西方散白蚁(*Reticulitermes hesperus*) (西方土栖白蚁)、桑特散白蚁(*Reticulitermes santonensis*)、栖北散白蚁(*Reticulitermes speratus*)、美黑胫散白蚁(*Reticulitermes tibialis*)、美小黑散白蚁(*Reticulitermes virginicus*)、长鼻散白蚁属种(*Schedorhinotermes spp.*)和古白蚁属种(*Zootermopsis spp.*) (腐木白蚁)。

[0086] 鳞翅目(*Lepidoptera*) (蛾和蝶):*Achoea janata*, 褐带卷蛾属种(*Adoxophyes spp.*)、棉褐带卷蛾(*Adoxophyes orana*)、地虎属种(*Agrotis spp.*) (切根虫)、小地蚕((*Agrotis ipsilon*) (黑切根虫)、棉叶波纹夜蛾(*Alabama argillacea*) (棉叶虫(cottonleaf worm))、*Amorbia cuneana*, *Amyelosi transitella* (navel orange worm)、*Anacamptodes defectaria*、棉条麦蛾 (*Anarsia lineatella*) (peach twig borer)、黄麻桥夜蛾(*Anomis sabulijera*) (jute looper)、黎豆夜蛾(*Anticarsia emmatalis*) (velvetbean caterpillar)、果树卷叶蛾(*Archips argyrospila*) (fruit tree leafroller)、蔷薇卷叶蛾(*Archips rosana*) (rose leafroller)、卷蛾属种(*Argyrotaenia spp.*) (tortricid moths)、桔带卷蛾(*Argyrotaenia citrana*) (柑桔卷叶蛾(orange tortrix))、*Autographa gamma*、*Bonagota cranaodes*、稻纵卷叶螟(*Borbotocinnara*) (rice leafroller)、棉叶潜蛾(*Bucculatrix thurberiella*) (cottonleaf perforator)、细蛾属种(*Caloptilia spp.*) (潜叶蛾)、*Capua reticulana*、桃蛀果蛾(*Carposina niponensis*) (桃果蛾(peach fruit moth))、禾草螟属种 (*Chilo spp.*)、芒果横线尾夜蛾(*Chlumetia transversa*) (mango shoot borer)、玫瑰色卷蛾 (*Choristoneura rosaceana*) (oblique banded leaf roller)、夜蛾属种(*Chrysodeixis spp.*)、稻纵卷叶野螟(*Cnaphalocerus medinalis*) (草地卷叶蛾(grass leafroller))、豆粉蝶属种(*Colias spp.*)、荔枝叉纹细蛾(*Conpomorpha cramerella*)、芳香木蠹蛾(*Cossus cossus*) (木蠹蛾)、草螟属种 (*Crambus spp.*) (Sod webworms)、李小食心虫(*Cydia funebrana*) (李果蛾(plumfruit moth))、梨小食心虫(*Cydia molesta*) (东方食心虫(oriental fruit moth))、豌豆蛀荚蛾(*Cydia nigricana*) (pea moth)、苹果蠹蛾(*Cydia pomonella*) (苹果小卷蛾(codling moth))、*Darna diducta*、绢野螟属种(*Diaphania spp.*) (蛀茎虫(stem borer))、螟属种(*Diatraea spp.*) (蛀茎虫 (stalk borer))、小蔗螟(*Diatraea saccharalis*) (sugarcane borer)、西南玉米秆草螟(*Diatraea graniosella*) (southwestern cornborer)、金刚钻属种(*Earias spp.*) (棉铃虫)、埃及金刚钻(*Earias insulata*) (Egyptian bollworm)、翠纹金刚钻(*Earias vitellus*) (rough northern bollworm)、*Ecdyttopopha aurantiana*、南美玉米苗斑螟(*Elasmopalpus lignosellus*) (lesser cornstalk borer)、浅褐苹果蛾(*Epiphyas postvittana*) (light brown apple moth)、粉斑螟属种(*Ephestia spp.*) (粉螟)、粉斑螟(*Ephestia cautella*) (almond moth)、烟草粉斑螟(*Ephestia elutella*) (烟草螟(tobacco moth))、地中海粉螟(*Ephestia kuehniella*) (Mediterranean flour moth)、*Epimeces*属种(*Epimeces spp.*)、夜小卷蛾(*Epinotia aporema*)、香蕉弄蝶(*Erionota thrax*) (banana skipper)、女贞细卷蛾(*Eupoecilia ambiguella*) (葡萄浆果蛾(grape berry moth))、原切根虫(*Euxoa auxiliaris*) (army cutworm)、地老虎属种(*Feltia spp.*) (切根虫)、角剑夜蛾属种(*Gortyna spp.*) (蛀茎虫)、东方蛀果蛾(*Grapholita molesta*) (桃(杏)子食心虫(oriental fruit moth))、三纹螟蛾 (*Hedylepta indicata*) (豆卷叶螟

(bean leaf webber))、青虫属种(*Helicoverpa* spp.) (夜蛾)、棉铃虫(*Helicoverpa armigera*) (cotton bollworm)、谷实夜蛾(*Helicoverpa* spp.) (玉米螟岭(螟岭虫/棉铃虫))、实夜蛾属种(*Heliothis* spp.) (夜蛾)、烟芽夜蛾(*Heliothis virescens*) (tobacco budworm)、菜心野螟(*Hellula undalis*) (cabbageweb worm)、Indarbela属种(*Indarbela* spp.) (根蛀虫)、番茄蠹蛾(*Keiferia lycopersicella*) (tomato pinworm)、茄白翅野螟(*Leucinodes orbonalis*) (eggplantfruit borer)、旋纹潜蛾(*Leucoptera malifoliella*)、细蛾属种(*Lithocolletis* spp.)、葡萄小卷叶蛾(*Lobesia botrana*) (grape fruit moth)、*Loxagrotis*属种(*Loxagrotis* spp.) (夜蛾)、豆白线切根虫(*Loxagrotis albicosta*) (western bean cutworm)、舞毒蛾(*Lymantria dispar*) (gypsy moth)、桃潜蛾(*Lyonetiaclella*) (苹果潜叶蛾(apple leafminer))、油棕榈袋蛾(*Mahasena corbetti*) (oil palm bagworm)、天幕毛虫属种(*Malacosoma* spp.) (tent caterpillars)、甘蓝夜蛾(*Mamestra brassicae*) (菜行军蛾(cabbage armyworm))、豆荚野螟(*Maruca testulalis*) (豆野螟)、袋蛾(*Metisa plana*) (结草虫)、*Mythimna unipuncta* (true armyworm)、*Neoleucinodes elegantalis* (小番茄蛀虫(small tomato borer))、三点水螟(*Nymphaulade punctalis*) (稻纵卷叶螟(rice leafroller))、冬尺蠖(*Operophtera brumata*) (winter moth)、欧洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis*) (欧洲玉米螟(European corn borer))、*Oxydia vesulia*、疆褐卷蛾 (*Pandemiscerasana*) (普通葡萄卷叶蛾(common currant tortrix))、苹褐卷蛾(*Pandemis heparana*) (brown apple tortrix)、非洲达摩凤蝶(*Papilio demodocus*)、红铃麦蛾 (*Pectinophora gossypiella*) (红铃虫(pink bollworm))、疆夜蛾属种(*Peridroma* spp.) (切根虫)、杂色地老虎(*Peridroma saucia*) (variegated cutworm)、咖啡潜叶蛾(*Perileucoptera coffeella*) (white coffee leafminer)、马铃薯块茎蛾(*Phthorimaea operculella*) (potato tuber moth)、柑桔叶潜蛾(*Phyllocnistis citrella*)、细蛾属种(*Phyllonorycter* spp.) (潜叶蛾)、菜粉蝶(*Pieris rapae*) (外来菜青虫(imported cabbageworm))、首蓿绿夜蛾(*Plathypena scabra*)、印度谷斑蛾(*Plodia interpunctella*) (Indian meal moth)、菜蛾(*Plutella xylostella*) (diamondback moth)、葡萄浆果蛾(*Polychrosis viteana*) (grape berry moth)、桔果巢蛾(*Prays endocarpis*)、油橄榄巢蛾(*Prays oleae*) (olive moth)、粘虫属种(*Pseudaletia* spp.) (夜蛾)、*Pseudaletia unipunctata* (行军虫)、大豆夜蛾(*Pseudoplusia includens*) (soybean looper)、尺蠖 (*Rachiplusia nu*)、二化螟(*Chilo suppressalis*)、三化螟(*Scirpophaga incertulas*)、蛀茎夜蛾属种(*Sesamia* spp.) (蛀茎虫)、稻蛀茎夜蛾(*Sesamia inferens*) (pink rice stemborer)、粉茎螟(*Sesamianonagrioides*)、铜斑褐刺蛾(*Setora nitens*)、麦蛾(*Sitotroga cerealella*) (Angoumoisgrain moth)、葡萄长须卷蛾(*Sparganothis pilleriana*)、灰翅夜蛾属种(*Spodoptera* spp.) (行军虫)、甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua*) (甜菜行军虫(beet armyworm))、草地贪夜蛾(*Spodoptera frugiperda*) (秋季行军虫(fall armyworm))、南方灰翅夜蛾 (*Spodoptera oridania*) (南方行军虫(southern armyworm))、兴透夜蛾属种(*Synanthedon* spp.) (根蛀虫)、*Thecla basilides*、*Thermisia gemmatilis*、衣蛾(*Tineola bisselliella*) (webbingclothes moth)、粉斑夜蛾(*Trichoplusia ni*) (cabbage looper)、番茄斑潜蝇 (*Tuta absoluta*)、巢蛾属种(*Yponomeuta* spp.)、咖啡豹蠹蛾

(Zeuzeracoffeae) (red branchborer)、*Zeuzera pyrina* (梨豹蠹蛾 (leopard moth)) 和斜纹夜蛾 (*Spodoptera litura* (Fabricius))。

[0087] 食毛目 (Mallophaga) 羽虱 (chewing lice): 羊羽虱 (*Bovicola ovis*) (sheep biting louse)、火鸡短角羽虱 (*Menacanthus stramineus*) (雏鸡羽虱 (chicken bodylouse)) 和鸡羽虱 (*Menopon gallinae*) (普通鸡舍 (common hen house))。

[0088] 直翅目 (Orthoptera) (蚱蜢、蝗虫和蟋蟀): 黑斑阿纳螽 (*Anabrus simplex*) (摩门螽斯 (Mormon cricket))、蝼蛄 (*Gryllotalpidae*) (蝼蛄 (mole cricket))、东亚飞蝗 (*Locusta migratoria*)、蚱蜢属种 (*Melanoplus spp.*) (蚱蜢)、纲翅细刺螽 (*Microcentrum retinerve*) (角翅螽斯 (angular winged katydid))、*Pterophylla* 属种 (*Pterophylla spp.*) (螽斯)、*chistocerca gregaria*、叉尾螽斯 (*Scudderella furcata*) (叉尾灌丛树螽 (fork tailed bush katydid)) 和黑角隆脊蝗 (*Valanga nigricornis*)。

[0089] 虱目 (Phthiraptera) (吸吮虱 (sucking louse)): 吸血虱属种 (*Haematopinus spp.*) (牛虱和猪虱)、绵羊颚虱 (*Linognathus setosus*) (羊虱 (sheep louse))、头虱 (*Pediculus humanus capitis*) (体虱)、人体虱 (*Pediculus humanus humanus*) (体虱) 和阴虱 (*Phthirus pubis*) (阴虱 (crab louse))。

[0090] 蚤目 (Siphonaptera) (跳蚤): 犬栉首蚤 (*Ctenocephalides canis*) (dog flea)、猫栉首蚤 (*Ctenocephalides felis*) (cat flea) 和人蚤 (*Pulex irritans*) (human flea)。

[0091] 缨翅目 (Thysanoptera) (蓟马): 烟褐蓟马 (*Frankliniella fusca*) (tobacco thrip)、西方花蓟马 (*Frankliniella occidentalis*) (western flower thrips)、*Frankliniella shultzei*、威廉斯花蓟马 (*Frankliniella williamsi*) (玉米蓟马 (corn thrip))、温室蓟马 (*Heliethrips haemorrhoidalis*) (greenhouse thrip)、*Rhipiphorothrips cruentatus*、硬蓟马属种 (*Scirtothrips spp.*)、桔梗蓟马 (*Scirtothrips cirri*) (citrus thrip)、茶黄蓟马 (*Scirtothrips dorsalis*) (yellow tea thrips)、*Taeniothrips rhopalantennalis* 和蓟马属种 (*Thrips spp.*)。

[0092] 缨尾目 (Thysanura) (蛀虫 (bristletail)): 衣鱼属种 (*Lepisma saccharinum*) (蠹虫 (silverfish)) 和小灶衣鱼属种 (*Thermobia domestica*) (小灶鱼)。

[0093] 螨目 (Acarina) (螨 (mite) 和蜱 (tick)): 伍氏蜂盾螨 (*Acaropsis woodi*) (蜜蜂气管内寄生螨 (tracheal mite of honeybee))、粉螨属种 (*Acarus spp.*) (食物螨)、粗脚粉螨 (*Acarus siro*) (谷螨 (grain mite))、芒果芽螨 (*Aceria mangiferae*) (mango bud mite)、刺皮瘿螨属种 (*Aculops spp.*)、番茄刺皮瘿螨 (*Aculops lycopersici*) (tomato russet mite)、*Aculops pelekassi*、桔刺皮瘿螨 (*Aculus pelekassi*)、斯氏刺瘿螨 (*Aculus schlechtendali*) (苹果刺瘿螨 (apple rust mite))、美洲花蜱 (*Amblyomma americanum*) (lone star tick)、牛蜱属种 (*Boophilus spp.*) (蜱)、卵形短须蜱 (*Brevipalpus obovatus*) (privet mite)、紫红短须蜱 (*Brevipalpus phoenicis*) (red and black flat mite)、脂蜱属种 (*Demodex spp.*) (mange mites)、革蜱属种 (*Dermacentor spp.*) (硬蜱)、美洲狗蜱 (*Dermacentor variabilis*) (american dog tick)、屋尘螨 (*Dermatophagoides pteronyssinus*) (house dust mite)、始叶螨属种 (*Eotetranychus spp.*)、鹅耳枥始叶螨 (*Eotetranychus carpini*) (黄蜘蛛螨 (yellow spider mite))、上瘿螨属种 (*Epitimerus spp.*)、瘿螨属种 (*Eriophyes spp.*)、硬蜱属种 (*Ixodes spp.*) (蜱)、

全爪螨属种((*Metatetranychus* spp.))、猫耳螨(*Notoedres cati*)、小爪螨属种(*Oligonychus* spp.)、咖啡小爪螨(*Oligonychus coffee*)、冬青小爪螨(*Oligonychus ilicis*) (southern red mite)、全爪螨属种(*Panonychus* spp.)、桔全爪螨(*Panonychus cirri*) (桔红蜘蛛(citrus red mite))、苹果全爪螨(*Panonychus ulmi*) (欧洲红蜘蛛(European red mite))、桔皱叶刺瘿(*Phyllocoptruta oleivora*) (citrus rust mite)、侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonemus latus*) (广明螨(broad mite))、血红扇头蜱(*Rhipicephalus sanguineus*) (褐狗蜱(brown dog tick))、根螨属种(*Rhizoglyphus* spp.) (根螨(bulb mite))、疥螨(*Sarcoptes scabiei*) (itch mite)、鳄梨顶冠瘿螨(*Tegolophus perseae florum*)、叶螨属种(*Tetranychus* spp.)、二点叶螨(*Tetranychus urticae*) (二点蜘蛛螨(twospotted spider mite))和狄氏瓦螨(*Varroa destructor*) (蜜蜂螨)。

[0094] 线虫纲(线虫):滑刃线虫属种(*Aphelenchoides* spp.) (芽和叶以及松材线虫(bud and leaf&pine wood nematode))、刺线虫属种(*Belonolaimus* spp.) (sting nematodes)、小环线虫属种(*Criconemella* spp.) (ring nematodes)、犬恶丝虫(*Dirofilaria immitis*) (dog heartworm)、茎线虫属种(*Ditylenchus* spp.) (茎和球茎线虫)、棘皮线虫属种(*Heterodera* spp.) (cyst nematode)、玉米胞囊线虫(*Heterodera zeae*) (corn cyst nematode)、潜根线虫属种(*Hirschmanniella* spp.) (root nematodes)、纽带线虫属种(*Hoplolaimus* spp.) (lance nematodes)、根结线虫属种(*Meloidogyne* spp.) (根结线虫)、南方根结线虫((*Meloidogyne incognita*) (根结线虫)、旋盘尾丝虫(*Onchocerca volvulus*) (hook-tail worm)、短体线虫属种(*Prae-Lylenchus* spp.) (腐线虫(lesion nematode))、穿孔线虫属种(*Radopholus* spp.) (穿孔线虫(burrowing nematode))和香蕉肾状线虫(*Rotylenchus reniformis*) (kidney-shaped nematode)。

[0095] 综合纲(综合虫类):白松虫(*Scutigera immaculata*)。

[0096] 由于其积极的特性,式(I)化合物可有利地用于保护农业和园艺业重要的作物、家畜和种畜,以及人类常去的环境免于害虫和/或害螨的伤害。

[0097] 为获得理想效果,式(I)化合物的用量因各种因素而改变,例如所用化合物、预保护的作物、有害生物的类型、感染程度、气候条件、施药方法和采用的剂型。

[0098] 本文中所述剂型或组合物成分的选择应与有效成分的物理性质,应用方式和环境因素例如土壤类型,湿度与温度相一致。

[0099] 有用的剂型包括液剂如溶液(包括乳油),悬浮剂,乳液(包括微乳剂和/或悬浮剂)等等,它们可任选被粘稠成胶状物。有用的剂型也包括固体的如粉剂,粉末,颗粒剂,片剂,丸剂,薄膜等,它们可以是水分散性的(“可湿的”)或水溶性的。有效成分可被微囊化再制成悬浮剂或固体剂型;另外有效成分的整个剂型也可以成胶囊化。成胶囊可以控制或延缓释放有效成分。可喷雾剂型可在适当的介质中冲稀,使用的喷雾体积为每公顷大约一百至几百升。高浓度的组合物主要用作进一步加工的中间体。

[0100] 典型的固体稀释剂在Watkins等人,Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers,2nd Ed.,Dorland Books,Caldwell,New Jersey中作了介绍。典型的液体稀释剂在Marsden,Solvents Guide,2nd Ed.,Interscience,New York,1950中作了介绍。McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual,Allured Publ.Corp.,Ridgewood,New Jersey,以及Sisely and Wood,Encyclopedia of Surface Active Agents,Chemical

Publ.Co., Inc., New York, 1964, 列出了表面活性剂和推荐应用。所有剂型都可含有少量的添加剂,以减少泡沫,结并,腐蚀,微生物的生长等,或加增稠剂以增加粘度。

[0101] 表面活性剂包括,例如,聚乙氧基化醇,聚乙氧基化烷基酚,聚乙氧基化脱水山梨醇脂肪酸酯,磺化丁二酸二烷基酯,硫酸烷基酯,烷基苯磺酸盐,有机硅烷,N,N-二烷基牛磺酸酯,木质素磺酸盐,萘磺酸盐用醛缩合物,聚羧酸酯和聚氧乙烯/聚氧丙烯嵌段共聚物。

[0102] 固体稀释剂包括,例如,粘土,如膨润土,蒙脱石,硅镁土和高岭土,淀粉,糖,二氧化硅,滑石,硅藻土,尿素,碳酸钙,碳酸钠和碳酸氢钠,和硫酸钠,液体稀释剂包括,例如,水,N,N-二甲基甲酰胺,二甲砒,N-烷基吡咯啉酮,乙二醇,聚丙二醇,石蜡,烷基苯,烷基萘,橄榄油,蓖麻油,亚麻籽油,桐油,芝麻油,玉米油,花生油,棉籽油,大豆油,菜籽油和可可油,脂肪酸酯,酮类如环己酮,2-庚酮,异佛尔酮和4-羟基-4-甲基-2-戊酮,和醇类如甲醇,环己醇,十二烷醇和四氢呋喃醇。

[0103] 溶液,包括乳油,可以通过简单地混合各组分来制备。粉剂和细粉可通过混合和通常在锤磨或液能磨中通过研磨来制备悬浮剂一般通过湿磨来制备;见,例如,U.S. 3060,084,颗粒剂和丸剂通过将有效物质喷到刚制成的颗粒载体上或通过造粒技术来制备。See Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4TH Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, Pages 8-57 and following, and WO 91/13546. 丸剂的制备如U.S. 4172714中介绍,水分散性和水溶性剂如U.S. 4144050, U.S. 3920442和DE 3246493中所述的方法来制备片剂如在US 5180587, U.S. 5232701和U.S. 5208030中所述的方法来制备。薄膜可通过在GB2095558和U.S. 3299566中所述的方法来制备。

[0104] 有关加工的更多信息可见U.S. 3,235,361, Col. 6, line 16 through Col. 7, line 19 and Examples 10-41; U.S. 3,309,192, Col. 5, line 43 through Col. 7, line 62 and Examples 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 and 169-182; U.S. 2,891,855, Col. 3, line 66 through Col. 5, line 17 and Examples 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York 1961, pp 81-96; and Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989.

[0105] 本文中,对于所述组合物的某些应用,例如在农业上可在本发明的杀虫和/或杀螨组合物中加入一种、两种或多种其它的杀菌剂、杀虫杀螨剂、除草剂、植物生长调节剂或肥料等,由此可产生附加的优点和效果。

[0106] 有益效果

[0107] 本发明所述式(I)化合物对农业或其他领域中的多种害虫、害螨都表现出很好的活性。并且,这些化合物在很低的剂量下就可以获得很好的防治效果,因此可用于制备杀虫和/或杀螨剂。

[0108] 术语定义与说明

[0109] 除非另有定义,否则本文所有科技术语具有的涵义与权利要求主题所属领域技术人员通常理解的涵义相同。除非另有说明,本文全文引用的所有专利、专利申请、公开材料通过引用方式整体并入本文。如果本文对术语有多个定义,以本章的定义为准。

[0110] 应当理解,可在参考文献(包括Carey and Sundberg "ADVANCED ORGANIC

CHEMISTRY 4TH ED. "Vols.A(2000) and B(2001), Plenum Press, New York) 中找到对标准化学术语的定义。除非另有说明, 否则采用本领域技术范围内的常规方法, 如质谱、NMR、IR和UV/Vis光谱法和药理学方法。除非提出具体定义, 否则本文在分析化学、有机合成化学以及药物和药物化学的有关描述中采用的术语是本领域已知的。可在化学合成、化学分析、药物制备、制剂和递送, 以及对患者的治疗中使用标准技术。例如, 可利用厂商对试剂盒的使用说明, 或者按照本领域公知的方式或本申请的说明来实施反应和进行纯化。通常可根据本说明书中引用和讨论的多个概要性和较具体的文献中的描述, 按照本领域熟知的常规方法实施上述技术和方法。在本说明书中, 可由本领域技术人员选择基团及其取代基以提供稳定的结构部分和化合物。当通过从左向右书写的常规化学式描述取代基时, 该取代基也同样包括从右向左书写结构式时所得到的在化学上等价的取代基, 只要其符合价键规则即可。举例而言, CH_2O 等同于 OCH_2 , 可以以氧原子或亚甲基的碳原子与取代位置连接。

[0111] 本文所用术语“药学上可接受的盐”是指保留了指定化合物的游离酸和游离碱的生物效力, 并且在生物学或其它方面上没有不良作用的盐。本申请化合物还包括药学上可以接受的盐, 例如硝酸盐、盐酸盐、硫酸盐、磷酸盐、乙酸盐、三氟乙酸盐、苹果酸盐或柠檬酸盐等一般在农园艺领域能够使用的盐等。药学上可接受的盐是指把母体化合物中的碱基基团转换成盐的形式。药学上可接受的盐包括, 但不仅限于, 碱基基团例如胺(氨)基的无机或有机酸盐类。本申请药学上可接受的盐可以由母体化合物合成, 即母体化合物中的碱性基团与1-4 当量的酸在一个溶剂系统中反应。合适的盐列举在Remington's Pharmaceutical Sciences, 17thed., Mack Publishing Company, Easton, Pa., 1985, p.1418和Journal of Pharmaceutical Science, 66, 2 (1977) 中, 例如盐酸盐。

[0112] 本文使用的“立体异构体”是指由分子中原子在空间上排列方式不同所产生的异构体。式(I)化合物含有不对称或手性中心, 因此, 存在不同的立体异构形式。式(I)的所有立体结构和混合物一样, 包括外消旋混合物, 作为目前申请的一部分。非对映体混合物能够分离成单独的非对映体, 基于它们不同的物理化学性质, 采用众所周知的手段, 例如, 对映异构体的拆分可通过与适当的光学活性物质(例如手性醇或Mosher's莫氏酰氯)反应转换为非对映异构体, 将其分离并转化(如水解)为相对应的单一的异构体。式(I)中的一些化合物可能是阻转异构体(如取代芳基)也是本申请中的一部分。对映异构体也可利用手性色谱柱分离。式(I)中的化合物可能存在着不同的互变异构形式, 这些形式都包含在本申请范围内。例如, 酮-烯醇和亚胺-烯胺形式的化合物。

具体实施方式

[0113] 下文将结合具体实施例对本发明的技术方案做更进一步的详细说明。应当理解, 下列实施例仅为示例性地说明和解释本发明, 而不应被解释为对本发明保护范围的限制。凡基于本发明上述内容所实现的技术均涵盖在本发明旨在保护的范围内。

[0114] 除非另有说明, 以下实施例中使用的原料和试剂均为市售商品, 或者可以通过已知方法制备。

[0115] 下述实施例中LC-MS检测分析使用如下色谱条件:

[0116] 色谱柱: Agilent ZORBAX SB-C18 150mm×4.6mm, 5 μm (i.d.);

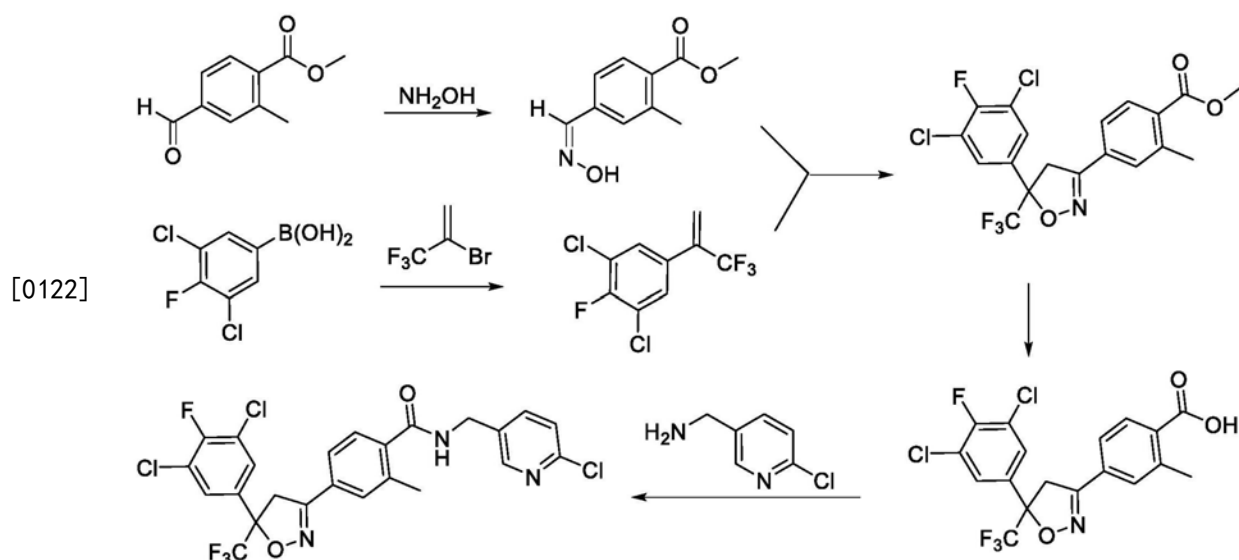
[0117] 检测波长: 254nm; 流速: 0.8mL/min; 柱温: 30℃;

[0118] 梯度洗脱条件:

时间 (min)	甲醇 (%)	0.1甲酸水溶液 (体积%)
0.00	50	50
5.00	50	50
15.00	90	10
20.00	90	10
25.00	90	10

[0120] 合成实施例

[0121] 实施例1:N-((6-氯吡啶-3-基)甲基)-4-(5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢异噁唑-3-基)-2-甲基苯甲酰胺(化合物1)的制备



[0123] 第一步反应:(Z)-4-((肟)甲基)-2-甲基苯甲酸甲酯的制备:室温下,依次将17.80g (0.1mol) 4-甲酰基-2-甲基苯甲酸甲酯、8.35g (0.12mol) 盐酸羟胺、12.30g (0.15mol) 乙酸钠溶于50ml水与200ml乙醇混合溶液中。反应液搅拌5小时。浓缩反应混合物,用乙酸乙酯和氢氧化钠水溶液(2M)稀释,分相。有机层饱和食盐水洗,无水硫酸钠干燥。抽滤,干燥得产品17.76g,收率92%。

[0124] LC-MS $[M+H]^+ = 194.08$ 、 $[M+Na]^+ = 216.06$ 、 $[M+K]^+ = 232.03$ 。

[0125] 第二步反应:1,3-二氯-2-氟-5-(3,3,3-三氟丙-1-烯-2-基)苯的制备:氮气保护下,室温将4.18g (0.02mol) 3,5-二氯-4-氟苯硼酸、6.90g (0.05mol) 碳酸钾、0.35g (0.0005mol) 二(三苯基膦)氯化钯及80ml甲苯加入到三口瓶中搅拌。向上述混合物中分批加入5.25g (0.03mol) 2-溴-3,3,3-三氟丙-1-烯。加毕,80℃下搅拌反应9小时。反应液冷至室温,向上述反应液中加入50ml水。分相。水层用甲苯(2*30ml)萃取,合并有机相。饱和食盐水洗。无水硫酸钠干燥,过滤。滤液减压浓缩,柱层析,洗脱剂:乙酸乙酯:石油醚(1:8)得产品3.41g,收率66%。

[0126] LC-MS $[M+H]^+ = 258.97$ 、 $[M+Na]^+ = 280.95$ 、 $[M+K]^+ = 296.92$ 。

[0127] 第三步反应:4-(5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢异噁唑-3-基)-2-甲基苯甲酸甲酯的制备:室温下,将3.86g (0.02mol) (Z)-4-((肟)甲基)-2-甲基苯甲酸甲酯、4.45g (0.033mol) N-氯代丁二酰亚胺、35ml N,N-二甲基甲酰胺加入到三口瓶中,

在40℃下搅拌反应2小时。反应液冷至室温,向上述混合物中加入4.40g (0.017mol) 1,3-二氯-2-氟-5-(3,3,3-三氟丙-1-烯-2-基)苯、3.33g (0.033mol) 三乙胺的20ml N,N-二甲基甲酰胺溶液,室温下搅拌20小时。用水和乙酸乙酯稀释反应混合物,分相。有机相水洗两次,水相用乙酸乙酯萃取两次。合并有机相,饱和食盐水洗,无水硫酸钠干燥。过滤,滤液减压浓缩。残余物柱层析,洗脱剂:乙酸乙酯:石油醚(1:6),得产品2.52g,收率33%。

[0128] LC-MS $[M+H]^+ = 450.03$ 、 $[M+Na]^+ = 472.01$ 、 $[M+K]^+ = 487.98$ 。

[0129] 第四步反应:4-(5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢异噁唑-3-基)-2-甲基苯甲酸的制备:室温下将2.25g (0.005mol) 4-(5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢异噁唑-3-基)-2-甲基苯甲酸甲酯加入到10ml 2N氢氧化钠水溶液中,10ml四氢呋喃稀释。反应混合物搅拌2小时,用1M稀盐酸调节pH=2。抽滤,滤饼用水洗涤,干燥后得产品2.01g,收率92%。

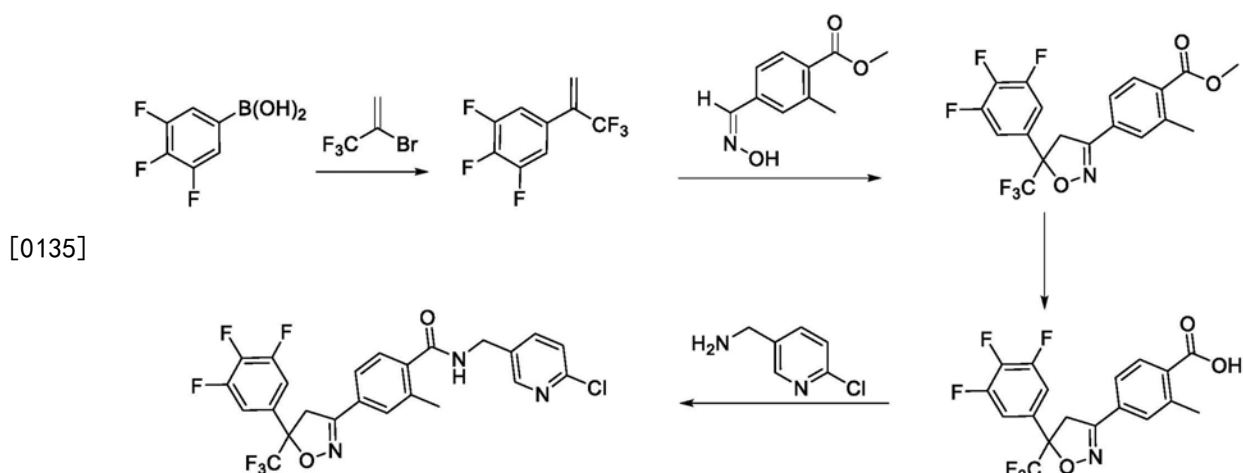
[0130] LC-MS $[M+H]^+ = 436.02$ 、 $[M+Na]^+ = 458$ 、 $[M+K]^+ = 473.97$ 。

[0131] 第五步反应:N-((6-氯吡啶-3-基)甲基)-4-(5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢异噁唑-3-基)-2-甲基苯甲酰胺的制备:0℃下,将1.75g (0.004mol) 4-(5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢异噁唑-3-基)-2-甲基苯甲酸、1.03g (0.008mol) 二(异丙基)乙胺、2.29g (0.0044mol) 六氟磷酸苯并三唑-1-基-氧基三吡咯烷基磷依次溶于30ml二氯甲烷中。反应混合物搅拌2小时。室温下向上述溶液中加入0.68g (0.0048mol) (6-氯吡啶-3-基)甲胺。室温下继续搅拌12小时。向反应体系中加入20ml水,分相。水相用二氯甲烷萃取两次。合并有机相,饱和食盐水洗,无水硫酸镁干燥。有机相减压脱溶,柱层析,洗脱剂:乙酸乙酯:石油醚(1:3)得产品1.61g,收率72%。

[0132] LC-MS $[M+H]^+ = 560.03$ 、 $[M+Na]^+ = 582.01$ 、 $[M+K]^+ = 597.98$ 。

[0133] $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, 溶剂 CDCl_3) δ (ppm): 8.42 (1H, s), 7.75 (1H, d), 7.58 (2H, d), 7.51 (2H, d), 7.42 (1H, d), 7.36 (1H, d), 6.24 (1H, s), 4.63 (2H, s), 4.07 (1H, d), 3.68 (1H, d), 2.47 (3H, s)。

[0134] 实施例2:N-((6-氯吡啶-3-基)甲基)-2-甲基-4-(5-(三氟甲基)-5-(3,4,5-三氟苯基)-4,5-二氢异噁唑-3-基)苯甲酰胺(化合物2)的制备



[0136] 第一步反应:1,2,3-三氟-5-(3,3,3-三氟丙-1-烯-2-基)苯的制备:氮气保护下,室温将3.52g (0.02mol) 3,4,5-三氟苯硼酸、6.90g (0.05mol) 碳酸钾、0.35g (0.0005mol) 二(三苯基膦)氯化钯及80ml甲苯加入到三口瓶中搅拌。向上述混合物中分批加入5.25g

(0.03mol) 2-溴-3,3,3-三氟丙-1-烯。加毕, 80℃下搅拌反应9小时。反应液冷至室温, 向上述反应液中加入50ml 水。分相。水层用甲苯 (2*30ml) 萃取, 合并有机相。饱和食盐水洗。无水硫酸钠干燥, 过滤。滤液减压浓缩, 柱层析, 洗脱剂: 乙酸乙酯: 石油醚 (1:8) 得产品3.25g, 收率72%。

[0137] LC-MS $[M+H]^+ = 227.03$ 、 $[M+Na]^+ = 249.01$ 、 $[M+K]^+ = 264.98$ 。

[0138] 第二步反应: 2-甲基-4-(5-(三氟甲基)-5-(3,4,5-三氟苯基)-4,5-二氢异噁唑-3-基) 苯甲酸甲酯的制备: 室温下, 将3.86g (0.02mol) (Z)-4-((呋) 甲基)-2-甲基苯甲酸甲酯、4.45g (0.033mol) N-氯代丁二酰亚胺、35ml N,N-二甲基甲酰胺加入到三口瓶中, 在40℃下搅拌反应2小时。反应液冷至室温, 向上述混合物中加入3.84g (0.017mol) 1,2,3-三氟-5-(3,3,3-三氟丙-1-烯-2-基) 苯、3.33g (0.033mol) 三乙胺的20ml N,N-二甲基甲酰胺溶液, 室温下搅拌20小时。用水和乙酸乙酯稀释反应混合物, 分相。有机相水洗两次, 水相用乙酸乙酯萃取两次。合并有机相, 饱和食盐水洗, 无水硫酸钠干燥。过滤, 滤液减压浓缩。残余物柱层析, 洗脱剂: 乙酸乙酯: 石油醚 (1:6), 得产品2.69g, 收率38%。

[0139] LC-MS $[M+H]^+ = 418.09$ 、 $[M+Na]^+ = 440.07$ 、 $[M+K]^+ = 456.04$ 。

[0140] 第三步反应: 2-甲基-4-(5-(三氟甲基)-5-(3,4,5-三氟苯基)-4,5-二氢异噁唑-3-基) 苯甲酸的制备: 室温下将2.09g (0.005mol) 2-甲基-4-(5-(三氟甲基)-5-(3,4,5-三氟苯基)-4,5-二氢异噁唑-3-基) 苯甲酸甲酯加入到10ml 2N氢氧化钠水溶液中, 10ml 四氢呋喃稀释。反应混合物搅拌2小时, 用1M稀盐酸调节pH=2。抽滤, 滤饼用水洗涤, 干燥后得产品1.91g, 收率95%。

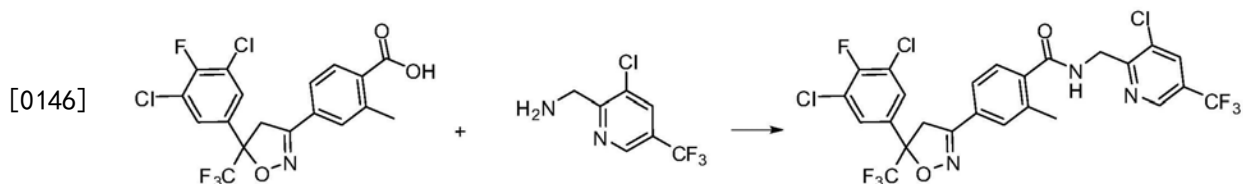
[0141] LC-MS $[M+H]^+ = 404.07$ 、 $[M+Na]^+ = 426.05$ 、 $[M+K]^+ = 442.02$ 。

[0142] 第四步反应: N-((6-氯吡啶-3-基) 甲基)-2-甲基-4-(5-(三氟甲基)-5-(3,4,5-三氟苯基)-4,5-二氢异噁唑-3-基) 苯甲酰胺的制备: 0℃下, 将1.61g (0.004mol) 2-甲基-4-(5-(三氟甲基)-5-(3,4,5-三氟苯基)-4,5-二氢异噁唑-3-基) 苯甲酸、1.03g (0.008mol) 二(异丙基) 乙胺、2.29g (0.0044mol) 六氟磷酸苯并三唑-1-基-氧基三吡咯烷基磷依次溶于30ml 二氯甲烷中。反应混合物搅拌2小时。室温下向上述溶液中加入0.68g (0.0048mol) (6-氯吡啶-3-基) 甲胺。室温下继续搅拌12小时。向反应体系中加入20ml 水, 分相。水相用二氯甲烷萃取两次。合并有机相, 饱和食盐水洗, 无水硫酸镁干燥。有机相减压脱溶, 柱层析, 洗脱剂: 乙酸乙酯: 石油醚 (1:2) 得产品1.58g, 收率75%。

[0143] LC-MS $[M+H]^+ = 528.09$ 、 $[M+Na]^+ = 550.07$ 、 $[M+K]^+ = 566.04$ 。

[0144] $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, 溶剂 CDCl_3) δ (ppm): 8.42 (1H, s), 7.75 (1H, d), 7.57 (2H, d), 7.46 (2H, d), 7.42 (1H, d), 7.36 (1H, d), 6.24 (1H, s), 4.63 (2H, s), 4.07 (1H, d), 3.68 (1H, d), 2.47 (3H, s)。

[0145] 实施例3: N-((3-氯-5-(三氟甲基) 吡啶-2-基) 甲基)-4-(5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢异噁唑-3-基)-2-甲基苯甲酰胺 (化合物9) 的制备



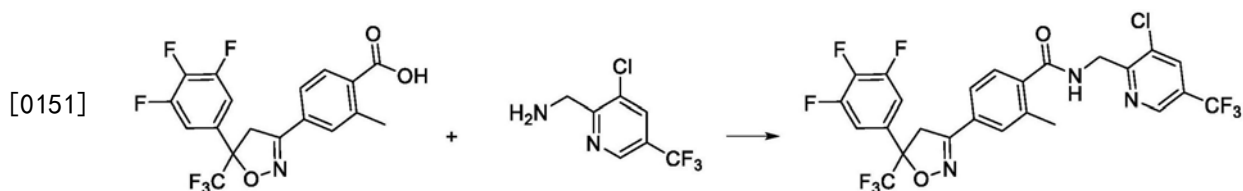
[0147] 0℃下, 将1.75g (0.004mol) 4-(5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢

异噁唑-3-基)-2-甲基苯甲酸、1.03g (0.008mol) 二(异丙基)乙胺、2.29g (0.0044mol) 六氟磷酸苯并三唑-1-基-氧基三吡咯烷基磷依次溶于30ml二氯甲烷中。反应混合物搅拌2小时。室温下向上述溶液中加入1.01g (0.0048mol) 3-氯-5(三氟甲基)吡啶-2-基)甲胺。室温下继续搅拌15小时。向反应体系中加入20ml水,分相。水相用二氯甲烷萃取两次。合并有机相,饱和食盐水洗,无水硫酸镁干燥。有机相减压脱溶,柱层析,洗脱剂:乙酸乙酯:石油醚(1:3)得产品1.61g,收率 72%。

[0148] LC-MS $[M+H]^+ = 628.02$ 、 $[M+Na]^+ = 650$ 、 $[M+K]^+ = 665.97$ 。

[0149] ^1H -NMR (400MHz, 溶剂 $CDCl_3$) δ (ppm): 8.22 (1H, s), 7.82 (1H, d), 7.78 (1H, d), 7.58 (2H, d), 7.51 (2H, d), 6.24 (1H, s), 4.63 (2H, s), 4.07 (1H, d), 3.68 (1H, d), 2.47 (3H, s)。

[0150] 实施例4:N-((3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基)甲基)-2-甲基-4-(5-(三氟甲基)-5-(3,4,5-三氟苯基)-4,5-二氢异噁唑-3-基)苯甲酰胺(化合物10)的制备



[0152] 0℃下,将1.61g (0.004mol) 2-甲基-4-(5-(三氟甲基)-5-(3,4,5-三氟苯基)-4,5-二氢异噁唑-3-基)苯甲酸、1.03g (0.008mol) 二(异丙基)乙胺、2.29g (0.0044mol) 六氟磷酸苯并三唑-1-基-氧基三吡咯烷基磷依次溶于30ml二氯甲烷中。反应混合物搅拌2小时。室温下向上述溶液中加入 1.01g (0.0048mol) 3-氯-5(三氟甲基)吡啶-2-基)甲胺。室温下继续搅拌15小时。向反应体系中加入20ml水,分相。水相用二氯甲烷萃取两次。合并有机相,饱和食盐水洗,无水硫酸镁干燥。有机相减压脱溶,柱层析,洗脱剂:乙酸乙酯:石油醚(1:2)得产品1.81g,收率76%。

[0153] LC-MS $[M+H]^+ = 596.08$ 、 $[M+Na]^+ = 618.06$ 、 $[M+K]^+ = 634.03$ 。

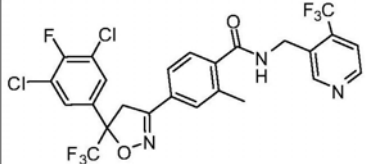
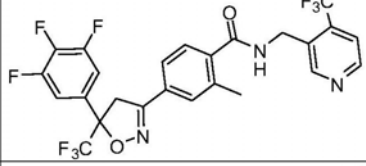
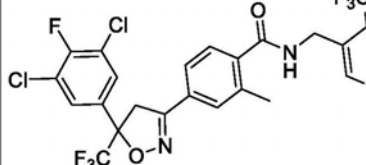
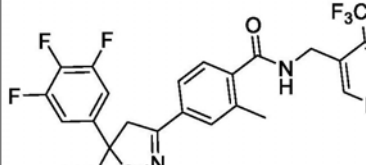
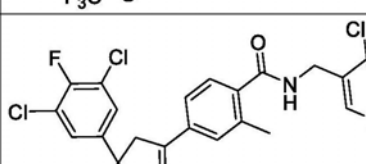
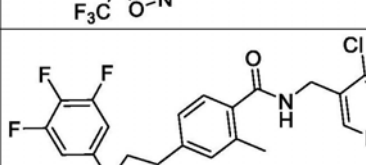
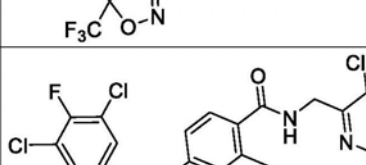
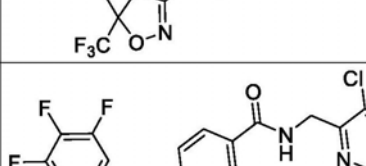
[0154] ^1H -NMR (400MHz, 溶剂 $CDCl_3$) δ (ppm): 8.21 (1H, s), 7.82 (1H, d), 7.76 (1H, d), 7.58 (2H, d), 7.21 (2H, d), 6.24 (1H, s), 4.63 (2H, s), 4.07 (1H, d), 3.68 (1H, d), 2.46 (3H, s)。

[0155] 本发明还参考上述实施例中的方法合成了如下化合物:

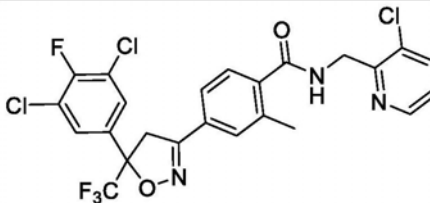
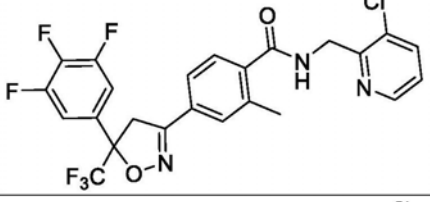
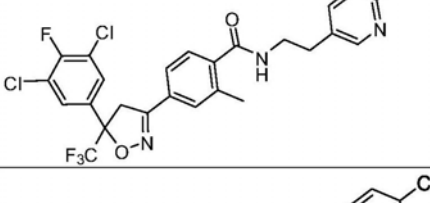
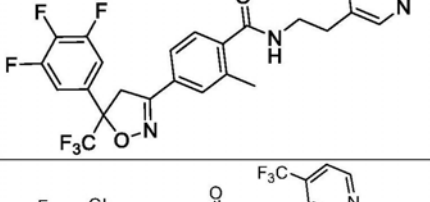
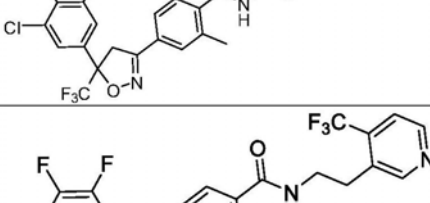
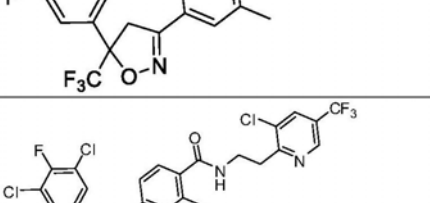
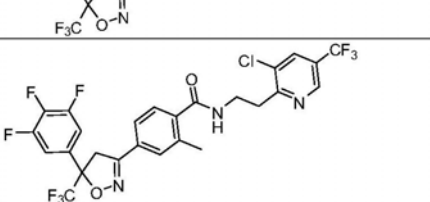
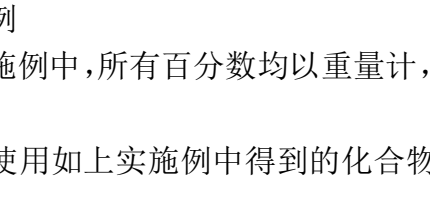
[0156] 表2

化合物编号	化合物结构	LC-MS
[0157]		

[0158]

3		$[M+H]^+=594.06$ 、 $[M+Na]^+=616.04$ 、 $[M+K]^+=632.01$
4		$[M+H]^+=562.12$ 、 $[M+Na]^+=584.1$ 、 $[M+K]^+=600.07$
5		$[M+H]^+=628.02$ 、 $[M+Na]^+=650$ 、 $[M+K]^+=665.97$
6		$[M+H]^+=596.08$ 、 $[M+Na]^+=618.06$ 、 $[M+K]^+=634.03$
7		$[M+H]^+=594$ 、 $[M+Na]^+=615.98$ 、 $[M+K]^+=631.95$
8		$[M+H]^+=562.05$ 、 $[M+Na]^+=584.03$ 、 $[M+K]^+=600$
11		$[M+H]^+=594$ 、 $[M+Na]^+=615.98$ 、 $[M+K]^+=631.95$
12		$[M+H]^+=562.05$ 、 $[M+Na]^+=584.03$ 、 $[M+K]^+=600$

[0159]

13		$[M+H]^+=560.03$ 、 $[M+Na]^+=582.01$ 、 $[M+K]^+=597.98$
14		$[M+H]^+=528.09$ 、 $[M+Na]^+=550.07$ 、 $[M+K]^+=566.04$
15		$[M+H]^+=574.05$ 、 $[M+Na]^+=596.03$ 、 $[M+K]^+=612$
16		$[M+H]^+=542.11$ 、 $[M+Na]^+=564.09$ 、 $[M+K]^+=580.06$
17		$[M+H]^+=608.08$ 、 $[M+Na]^+=630.06$ 、 $[M+K]^+=646.03$
18		$[M+H]^+=576.14$ 、 $[M+Na]^+=598.12$ 、 $[M+K]^+=614.09$
19		$[M+H]^+=642.04$ 、 $[M+Na]^+=664.02$ 、 $[M+K]^+=679.99$
20		$[M+H]^+=610.1$ 、 $[M+Na]^+=632.08$ 、 $[M+K]^+=648.05$

[0160] 制剂实施例

[0161] 在以下实施例中,所有百分数均以重量计,所有剂型都使用常规方法制备。

[0162] 实施例5:

[0163] 本实施例使用如上实施例中得到的化合物制备可湿性粉剂,具体采用如下配比的原料组成进行制备:

[0164] 化合物1 50.0%、十二烷基酚聚乙氧基乙二醇醚4.0%、木质素磺酸钠6.0%、硅铝

酸钠 8.0%、蒙脱石(煅烧的) 32.0%。

[0165] 实施例6:

[0166] 本实施例使用如上实施例中得到的化合物制备颗粒剂,具体采用如下配比的原料组成进行制备:

[0167] 化合物2 20.0%、其他组分为十二烷基硫酸钠2.0%、木质素磺酸钙6.0%、氯化钾 10.0%、聚二甲基硅氧烷1.0%、可溶性淀粉补齐至100%。

[0168] 实施例7:

[0169] 本实施例使用如上实施例中得到的化合物制备挤压丸,具体采用如下配比的原料组成进行制备:

[0170] 化合物3 30.0%、无水硫酸钙9.0%、粗木质素磺酸钙4.0%、烷基萘磺酸钠1.0%、钙/ 镁膨润土56.0%。

[0171] 实施例8:

[0172] 本实施例使用如上实施例中得到的化合物制备乳油,具体采用如下配比的原料组成进行制备:

[0173] 化合物9 25.0%、溶剂150 60%、PEG400 5%、Rhodacal 70/B 3%、Rhodameen RAM/7 7%。

[0174] 实施例9:

[0175] 本实施例使用如上实施例中得到的化合物制备水悬浮剂,具体采用如下配比的原料组成进行制备:

[0176] 化合物10 30.0%、POE聚苯乙烯苯基醚硫酸盐5.0%、黄原胶0.5%、聚乙二醇5%、三乙醇胺1%、山梨糖醇0.5%和水加至100.0%。

[0177] 生物活性测定

[0178] 实施例10:

[0179] 1、杀虫活性测定

[0180] 本实施例中使用上述实施例制备的化合物对几种昆虫进行了杀虫活性测定试验。

[0181] 杀虫活性测定:测试方法如下,将待测化合物样品用适合的溶剂(溶剂的种类如丙酮、甲醇、DMSO等,并且依据其对样品的溶解能力而选择)溶解,配制成所需浓度待测液。试验单元由内有12-15天龄萝卜植物的小开口容器构成。通过在试验植物的一片叶片上放置30-40 条位于一片从栽培植物上切下的叶片上的害虫(切叶方法)而将所述植物预先浸染。随着叶片脱水,害虫在试验植物上移动。预先浸染后,用一层砂覆盖试验单元的土壤。

[0182] 测试方法如下:将测试重复三次,将配制好的受试化合物喷雾后,使每个试验单元干燥 1小时,然后将黑色网盖放置在顶部。使试验单元在25℃和70%相对湿度的生长室中保持6 天。然后视觉评价每个试验单元的虫死亡率(致死率),致死率的计算方式为,

[0183]
$$\text{致死率 (\%)} = \frac{\text{死亡虫数}}{\text{处理总虫数}} \times 100\%$$

[0184] (1) 示例性的实施例化合物防治西花蓟马测试结果

[0185] 在25ppm剂量下,对西花蓟马的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20;

[0186] 在10ppm剂量下,对西花蓟马的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20;

[0187] 在1ppm剂量下,对西花蓟马的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20;

[0188] (2) 示例性的实施例化合物防治菜蛾的测试结果

[0189] 在10ppm剂量下,对菜蛾的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20;

[0190] 在1ppm剂量下,对菜蛾的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20;

[0191] 在0.1ppm剂量下,对菜蛾的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20。

[0192] (3) 示例性的实施例化合物防治菜粉蝶测试结果

[0193] 在10ppm剂量下,对菜粉蝶的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20;

[0194] 在1ppm剂量下,对菜粉蝶的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20;

[0195] 在0.1ppm剂量下,对菜粉蝶的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20。

[0196] (4) 示例性的实施例化合物防治粘虫测试结果

[0197] 在10ppm剂量下,对粘虫的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20;

[0198] 在1ppm剂量下,对粘虫的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20;

[0199] 在0.1ppm剂量下,对粘虫的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20。

[0200] (5) 示例性的实施例化合物防治斜纹夜蛾测试结果

[0201] 在10ppm剂量下,对斜纹夜蛾的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20;

[0202] 在1ppm剂量下,对斜纹夜蛾的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20;

[0203] 在0.1ppm剂量下,对斜纹夜蛾的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20。

[0204] (6) 示例性的实施例化合物防治二化螟的测试结果

[0205] 在10ppm剂量下,对二化螟的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20;

[0206] 在1ppm剂量下,对二化螟的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20;

[0207] 在0.1ppm剂量下,对二化螟的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20。

[0208] (7) 示例性的实施例化合物防治稻纵卷叶螟的测试结果

[0209] 在10ppm剂量下,对稻纵卷叶螟的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20;

[0210] 在1ppm剂量下,对稻纵卷叶螟的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20。

[0211] 在0.1ppm剂量下,对稻纵卷叶螟的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20。

[0212] 2、杀螨活性测定

[0213] 本实施例中使用上述实施例制备的化合物对几种螨类害虫进行了杀螨活性测定试验。

[0214] 测试方法如下:将待测化合物样品用适合的溶剂(溶剂的种类如丙酮、甲醇、DMSO等,并且依据其对样品的溶解能力而选择)溶解,配制成所需浓度待测液。将双面胶带剪成2~3cm长,贴在显微镜载玻片的一端,用镊子揭去胶带上的纸片,用零号毛笔挑选大小一致、体色鲜艳、行动活泼的雌成螨,将其背部粘在双面胶带上(注意:不要粘住螨足、螨须和口器),每片粘4行,每行粘10头。

[0215] 测试方法如下:将测试重复三次,在温度(25±1)℃,相对湿度85%左右的生化培养箱中放置4h后,用双目镜观察,剔除死亡或不活泼个体。将带螨玻片的一端浸入药液中,轻轻摇动5s后取出,迅速用吸水纸吸干螨体及其周围多余的药液。置于上述生化培养箱中,24h后用双目镜检查结果,用毛笔轻触螨体,以螨足不动者为死亡,并计算致死率。致死率计算方式如下:

$$[0216] \quad \text{致死率}(\%) = \frac{\text{死亡虫数}}{\text{处理总虫数}} \times 100\%$$

[0217] 对朱砂叶螨部分测定结果如下:

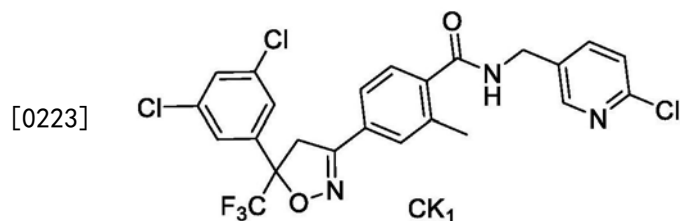
[0218] 在25ppm剂量下,对朱砂叶螨的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20;

[0219] 在10ppm剂量下,对朱砂叶螨的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20;

[0220] 在1ppm剂量下,对朱砂叶螨的致死率在80%以上的化合物有:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20。

[0221] 3、示例性的实施例化合物与对照药剂的测试结果

[0222] 本实施例进行了示例性的实施例化合物与对照药剂的活性对比试验(化合物CK₁为专利文献W02005085216中的编号5-241,根据文献报道方法制备)。测试结果见下表3。



[0224] 表3

[0225]

化合物	对粘虫的 致死率(%)			对二化螟的 致死率(%)			对菜蛾的 致死率(%)			对西花蓟马的 致死率(%)		
	10 ppm	1 ppm	0.1 ppm	10 ppm	1 ppm	0.1 ppm	10 ppm	1 ppm	0.1 ppm	25 ppm	10 ppm	1 ppm
1	100	100	95	100	100	90	100	100	100	100	100	95
2	100	100	85	100	100	80	100	100	85	100	100	90
9	100	100	100	100	100	95	100	100	100	100	100	95
10	100	100	85	100	100	85	100	100	90	100	100	85
CK ₁	100	80	10	100	50	0	100	80	15	80	40	0

[0226] 除上表中列举的化合物外,本发明其他示例性的实施例化合物对害虫、害螨的防治活性优于对照药剂。因此,本发明式(I)化合物对农业领域中的多种害虫、害螨都表现出很好的活性。

[0227] 以上,对本发明的实施方式进行了说明。但是,本发明不限定于上述实施方式。凡在本发明的精神和原则之内,所做的任何修改、等同替换、改进等,均应包含在本发明的保护范围之内。