



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 101801191 A

(43) 申请公布日 2010.08.11

(21) 申请号 200880025584.0

(51) Int. Cl.

(22) 申请日 2008.07.28

A01N 43/56 (2006.01)

(30) 优先权数据

A61K 31/4439 (2006.01)

60/962,518 2007.07.30 US

(85) PCT申请进入国家阶段日

2010.01.21

(86) PCT申请的申请数据

PCT/US2008/071303 2008.07.28

(87) PCT申请的公布数据

W02009/018195 EN 2009.02.05

(71) 申请人 纳慕尔杜邦公司

地址 美国特拉华州

(72) 发明人 W·S·泰勒

(74) 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公

司 72001

代理人 温宏艳 付磊

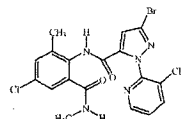
权利要求书 3 页 说明书 26 页

(54) 发明名称

飞蝇的防治方法

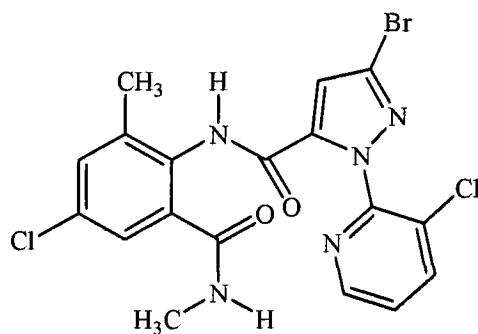
(57) 摘要

本发明涉及通过向动物施用组合物来防治或预防飞蝇对动物侵染的方法,所述组合物包含杀寄生物有效量的式1的化合物(3-溴-N-[4-氯-2-甲基-6-[(甲基氨基)羰基]苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-甲酰胺),或其N-氧化物,或其盐。



(I)

1. 通过向动物施用组合物来防治或预防叮咬飞蝇对所述动物侵染的方法,所述组合物包含杀寄生物有效量的式 1 的化合物



1

或其 N-氧化物,或药理学或兽医学可接受的盐。

2. 权利要求 1 的方法,其中所述飞蝇为厩蝇。

3. 权利要求 1 的方法,其中所述飞蝇为角蝇。

4. 权利要求 1 的方法,其中所述动物为成群动物。

5. 权利要求 4 的方法,其中所述动物为牛或羊。

6. 权利要求 1 至 5 中任一项的方法,其中所述组合物包含至少一种选自溶剂和 / 或载体、乳化剂和 / 或分散剂的附加组分。

7. 权利要求 6 的方法,并且其中所述组合物包含至少一种附加的生物学活性化合物或试剂。

8. 权利要求 7 的方法,其中所述附加的生物学活性化合物或试剂选自大环内酯类、乙酰基胆碱酯酶抑制剂、节肢动物生长调节剂、GABA 门控氯通道拮抗剂、线粒体电子转运抑制剂、烟碱型乙酰胆碱激动剂 / 拮抗剂 / 活化剂、氧化磷酸化抑制剂、驱肠虫剂、钠通道调节剂或其他抗寄生物化合物。

9. 权利要求 8 的方法,其中所述生物学活性化合物为大环内酯类。

10. 权利要求 8 的方法,其中所述生物学活性化合物为选自有机磷酸酯和氨基甲酸酯的乙酰基胆碱酯酶抑制剂。

11. 权利要求 8 的方法,其中所述生物学活性化合物为节肢动物生长调节剂,所述节肢动物生长调节剂选自甲壳质合成抑制剂、蜕皮激素激动剂 / 干扰素、脂质生物合成抑制剂和保幼激素模拟物。

12. 权利要求 8 的方法,其中所述生物学活性化合物为 GABA 门控氯通道拮抗剂。

13. 权利要求 8 的方法,其中所述生物学活性化合物为线粒体电子转运抑制剂。

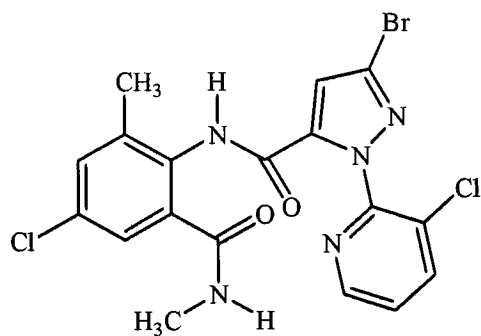
14. 权利要求 8 的方法,其中所述生物学活性化合物为烟碱型乙酰胆碱激动剂 / 拮抗剂 / 活化剂。

15. 权利要求 8 的方法,其中所述生物学活性化合物为氧化磷酸化抑制剂。

16. 权利要求 8 的方法,其中所述生物学活性化合物为驱肠虫剂。

17. 权利要求 8 的方法,其中所述生物学活性化合物为钠通道调节剂。

18. 通过向动物施用组合物来治疗动物蝇蛆病的方法,所述组合物包含杀寄生物有效量的式 1 的化合物



1

或其 N-氧化物或药理学或兽医学可接受的盐。

19. 权利要求 18 的治疗蝇蛆病方法,其中所述蝇蛆病至少部分地是由选自丽蝇分科、麻蝇分科或狂蝇分科的幼虫引起的。

20. 权利要求 18 的治疗方法,其中所述蝇蛆病至少部分地是由丽蝇科幼虫引起的。

21. 权利要求 18 的治疗方法,其中所述蝇蛆病至少部分地是由选自铜绿蝇和丝光绿蝇的幼虫引起的。

22. 权利要求 18 的治疗方法,其中所述蝇蛆病至少部分地是由铜绿蝇的幼虫引起的。

23. 权利要求 18 的治疗方法,其中所述蝇蛆病至少部分地是由丝光绿蝇的幼虫引起的。

24. 权利要求 18 的治疗方法,其中所述动物为牛或羊。

25. 权利要求 18-24 中任一项的方法,其中所述组合物包含至少一种选自溶剂和 / 或载体、乳化剂和 / 或分散剂的附加组分。

26. 权利要求 25 的方法,并且其中所述组合物包含至少一种附加的生物学活性化合物或试剂。

27. 权利要求 26 的方法,其中所述附加的生物学活性化合物或试剂选自大环内酯类、乙酰基胆碱酯酶抑制剂、节肢动物生长调节剂、GABA 门控氯通道拮抗剂、线粒体电子转运抑制剂、烟碱型乙酰胆碱激动剂 / 拮抗剂 / 活化剂、氧化磷酸化抑制剂、驱肠虫剂、钠通道调节剂或其他抗寄生物化合物。

28. 权利要求 27 的方法,其中所述生物学活性化合物为大环内酯类。

29. 权利要求 27 的方法,其中所述生物学活性化合物为选自有机磷酸酯和氨基甲酸酯的乙酰基胆碱酯酶抑制剂。

30. 权利要求 27 的方法,其中所述生物学活性化合物为节肢动物生长调节剂,所述节肢动物生长调节剂选自甲壳质合成抑制剂、蜕皮激素激动剂 / 干扰素、脂质生物合成抑制剂和保幼激素模拟物。

31. 权利要求 27 的方法,其中所述生物学活性化合物为 GABA 门控氯通道拮抗剂。

32. 权利要求 27 的方法,其中所述生物学活性化合物为线粒体电子转运抑制剂。

33. 权利要求 27 的方法,其中所述生物学活性化合物为烟碱型乙酰胆碱激动剂 / 拮抗剂 / 活化剂。

34. 权利要求 27 的方法,其中所述生物学活性化合物为氧化磷酸化抑制剂。

35. 权利要求 27 的方法,其中所述生物学活性化合物为驱肠虫剂。

36. 权利要求 26 的方法,其中所述生物学活性化合物为钠通道调节剂。

飞蝇的防治方法

发明领域

[0001] 本发明涉及用于防治动物体上叮咬飞蝇和丽蝇的某些方法。

[0002] 发明背景

[0003] 飞蝇不仅仅令人讨厌,它们还携带对人和动物健康具有严重危害的疾病。就全球而言,它们造成估计数十亿美元的牲畜和家禽产量损失。几乎所有家畜的生长和行为均受飞蝇的不利影响,尤其是当它们大量存在时。受侵染的动物变得烦躁,并且进食量显著降低。结果是,肉、奶和蛋产品显著下降,并且经济损失严重。

[0004] 非叮咬型飞蝇通常以从牲畜眼、鼻以及任何小伤口处分泌出的分泌物为食。这使得动物无法进食,致使生长和繁殖力降低。非叮咬型飞蝇虽然不是任何具体致病有机体的重要载体,但是由于它们摄食和繁殖习性,以及它们足和口器的结构,使得它们可担当从病毒至寄生虫全范围病原体的机械性载体。

[0005] 叮咬飞蝇甚至可致使家畜更加烦躁,并且它们也是疾病传播的载体。然而,由于它们以血为食,因此它们也会造成贫血和过敏。因此,某些人认为,对于牧业生产而言,叮咬飞蝇是比非叮咬型飞蝇更严重的问题。

[0006] 然而,通常被称为“丽蝇”的某些非叮咬型飞蝇由于它们致使易受感染动物患上蝇蛆病的倾向,从而它们自身可引起显著的危害。蝇蛆病是由以宿主坏死或活体组织为食的寄生性双翅目飞蝇幼虫引起的动物或人体疾病。丽蝇是澳大利亚养羊业中最主要的寄生虫。每年损失估计大于5千万美元。这些损失是由于羊生长减缓、羊毛产量降低并且低劣、以及花费在试图防治寄生虫上的极高人工成本所造成的。

[0007] 在正常条件下,丽蝇不会攻击健康的活羊。如果动物带有开放性伤口,例如由于打烙印或阉割而造成的开放性伤口,则某些种类的丽蝇会将卵放置于伤口中。这些卵将孵化成蛆,所述蛆以动物的肉为食。

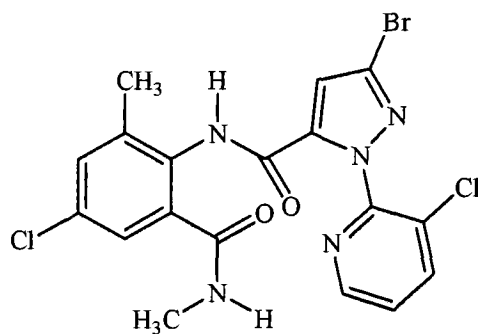
[0008] 叮咬飞蝇和丽蝇成虫种群的主要防治方法涉及向牲畜局部施用杀昆虫剂。通常使用常为喷雾制剂形式的有机磷或有机氯化物。

[0009] 迫切需要可用于治疗和预防蝇蛆病并且可用于防治叮咬飞蝇的改进的杀昆虫剂制剂,而本发明提出了这样的杀昆虫剂制剂。

[0010] 发明概述

[0011] 本发明涉及通过向动物施用组合物来防治或预防飞蝇对动物侵染的方法,所述组合物包含杀寄生物有效量的式1的化合物(3-溴-N-[4-氯-2-甲基-6-[(甲基氨基)羰基]苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-甲酰胺)(另外还被称为氯虫苯甲酰胺(ISO)-氯虫苯甲酰胺TM),或其N-氧化物,或其盐。

[0012]



1

[0013] 本发明还涉及通过向动物施用组合物来治疗动物蝇蛆病的方法，所述组合物包含杀寄生物有效量的式 1 的化合物，其 N- 氧化物，或其盐。

[0014] 本发明还包括用作药物的式 1 的化合物。

[0015] 本发明还涉及在用于治疗蝇蛆病或防治飞蝇对动物侵染的药物生产中使用式 1 的化合物。

[0016] 发明详述

[0017] 如本文所用，术语“包含”、“包括”、“具有”或“含有”，或者其任何其他变型旨在包括非排他的包括。例如，包含一系列元素的组合物、混合物、工艺、方法、制品或设备不必仅限于那些元素，而可以包括其他未明确列出的元素，或此类组合物、混合物、工艺、方法、制品或设备固有的元素。此外，除非有相反的明确说明，“或”是指包含性的“或”，而不是指排他性的“或”。例如，以下任何一种情况均满足条件 A 或 B：A 是真实的（或存在的）且 B 是虚假的（或不存在的），A 是虚假的（或不存在的）且 B 是真实的（或存在的），以及 A 和 B 都是真实的（或存在的）。

[0018] 同样，位于本发明元素或组分前的涉及元素或组分例证（即出现）次数的不定冠词“一个”或“一种”旨在是非限制性的。因此，应将“一个”或“一种”理解为包括一个或至少一个，并且元素或组分的词语单数形式也包括复数指代，除非有数字明显表示单数。

[0019] “飞蝇”是双翅目昆虫，是指“双翼的”。真蝇具有一对用于飞行的翅膀。翅膀后是一对柄球状结构（称为平衡棒），其为平缓器官。飞蝇经历完全变态，即生命周期由下列阶段组成：卵、幼虫（称为蛆）、蛹和成虫。生命周期的每个阶段均可以成为防治和干预的对象。

[0020] 飞蝇可被分为“叮咬”和“非叮咬”两种功能类别。

[0021] “叮咬飞蝇”具有极适于刺穿宿主动物皮毛的特别适合的口器。厩蝇（厩螫蝇）是叮咬飞蝇的一个适宜实例。厩蝇具有可用于刺穿皮肤并且吸取血液的喙。雄性和雌性均是食血的。厩蝇通常是圈栏式牲畜饲养场所内以及附近以任何适宜数目繁殖的唯一叮咬吸血飞虫。叮咬飞蝇的另一实例是角蝇（扰血蝇），与厩蝇一样，它也是吸血动物，并且对经济具有重大影响。与厩蝇一样，角蝇具有用于刺穿 / 吸取的口器。

[0022] “丽蝇”被定义为是蝇蛆病病原体的飞蝇。例如，丽蝇科以及麻蝇科和狂蝇科所包括的物种是造成家畜和人许多重要蝇蛆病的主要原因。在欧洲，丽蝇的主要物种包括丝光绿蝇（绿蝇）、伏蝇（黑蝇）、红头丽蝇和反吐丽蝇（青蝇）。这些飞蝇的特征在于它们躯体部分上的金属光泽颜色。铜绿蝇、金蝇、亮绿蝇、黑花蝇、幽暗丽蝇、澳洲丽蝇、C. fallax、白

头裸金蝇、*C. chlorophylla*、细须金蝇和红颜金蝇是热带和亚热带地区中的主要丽蝇物种实例。丽蝇是牧羊业尤其重要的问题。

[0023] 攻击羊的丽蝇分为两大类：

[0024] (1) 能够对活羊发起叮咬的一级飞蝇。这些包括绿蝇属和黑花蝇属物种以及某些丽蝇属物种。

[0025] (2) 不能发起叮咬，但是可攻击已被叮咬区域或受损区域的二级飞蝇。它们反复扩大受伤处，使叮咬处变得极为恶化。实例包括许多丽蝇属物种，以及金蝇属物种（在温暖气候下）。

[0026] 杀寄生物有效量是为达到观察得到的目标无脊椎寄生害虫出现率或活跃度降低的效果所需的活性分量。本领域的技术人员将会知道，杀寄生虫有效剂量可随本发明的不同化合物和组合物、所需的杀寄生虫效果和持续时间、目标无脊椎害虫物种、要保护的动物、施用模式等而不同，并且达到具体效果所需的量可通过简单的实验来确定。

[0027] “蝇蛆病”是由以动物宿主坏死或活体组织为食的寄生性双翅目飞蝇幼虫引起的动物疾病。蝇蛆病的俗语包括“蝇子疮”和“蝇子病”。羊皮蝇蛆病通常与羊相关；然而也可影响许多其他动物。

[0028] 当应用于蝇蛆病或侵染时，“治疗”或“处理”分别指预防和防治蝇蛆病或侵染。

[0029] 本发明的实施方案包括：

[0030] 实施方案 1：发明概述中所述的方法或用途，其中所述飞蝇为叮咬飞蝇。

[0031] 实施方案 2：实施方案 1 中所述的方法或用途，其中所述飞蝇为厩蝇。

[0032] 实施方案 3：实施方案 1 中所述的方法或用途，其中所述飞蝇为角蝇。

[0033] 实施方案 4：实施方案 1 至 3 中任一项所述的方法或用途，其中所述动物为成群动物。

[0034] 实施方案 5：实施方案 4 中所述的方法或用途，其中所述动物为牛或羊。

[0035] 实施方案 6：实施方案 1-5 中任一项所述的方法或用途，其中所述组合物包含至少一种选自溶剂和 / 或载体、乳化剂和 / 或分散剂的附加组分。

[0036] 实施方案 7：实施方案 6 中的方法或用途，并且其中所述组合物包含至少一种附加的生物学活性化合物或试剂。

[0037] 实施方案 8：实施方案 7 中的方法或用途，其中所述附加的生物学活性化合物或试剂选自大环内酯类、乙酰基胆碱酯酶抑制剂、节肢动物生长调节剂、GABA 门控氯通道拮抗剂、线粒体电子转运抑制剂、烟碱型乙酰胆碱激动剂 / 拮抗剂 / 活化剂、氧化磷酸化抑制剂、驱肠虫剂、钠通道调节剂或其他抗寄生物化合物。

[0038] 实施方案 9：实施方案 8 中的方法或用途，其中所述生物学活性化合物为大环内酯类。

[0039] 实施方案 10：实施方案 8 中的方法或用途，其中所述生物学活性化合物为乙酰基胆碱酯酶抑制剂，其选自有机磷酸酯和氨基甲酸酯。

[0040] 实施方案 11：实施方案 8 中的方法或用途，其中所述生物学活性化合物为节肢动物生长调节剂，其选自甲壳质合成抑制剂、蜕皮激素激动剂 / 干扰素、脂质生物合成抑制剂和保幼激素模拟物。

[0041] 实施方案 12：实施方案 8 中的方法或用途，其中所述生物学活性化合物为 GABA 门

控氯通道拮抗剂。

[0042] 实施方案 13 : 实施方案 8 中的方法或用途, 其中所述生物学活性化合物为线粒体电子转运抑制剂。

[0043] 实施方案 14 : 实施方案 8 中的方法或用途, 其中所述生物学活性化合物为烟碱型乙酰胆碱激动剂 / 拮抗剂 / 活化剂。

[0044] 实施方案 15 : 实施方案 8 中的方法或用途, 其中所述生物学活性化合物为氧化磷酸化抑制剂。

[0045] 实施方案 16 : 权利要求 8 中的方法或用途, 其中所述生物学活性化合物为驱肠虫剂。

[0046] 实施方案 17 : 权利要求 8 中的方法或用途, 其中所述生物学活性化合物为钠通道调节剂。

[0047] 实施方案 18 : 发明概述中所述的蝇蛆病的治疗方法或用途, 其中所述蝇蛆病至少部分地是由选自丽蝇分科、麻蝇分科或狂蝇分科的幼虫引起的。

[0048] 实施方案 19 : 实施方案 18 中的方法和用途, 其中所述蝇蛆病至少部分地是由选自丽蝇分科、麻蝇分科或狂蝇分科的幼虫引起的。

[0049] 实施方案 20 : 实施方案 18 中的方法和用途, 其中所述蝇蛆病至少部分地是由丽蝇科的幼虫引起的。

[0050] 实施方案 21 : 实施方案 18 中的方法和用途, 其中所述蝇蛆病至少部分地是由选自铜绿蝇和丝光绿蝇的幼虫引起的。

[0051] 实施方案 22 : 实施方案 18 中的方法和用途, 其中所述蝇蛆病至少部分地是由铜绿蝇的幼虫引起的。

[0052] 实施方案 23 : 实施方案 18 中的方法和用途, 其中所述蝇蛆病至少部分地是由丝光绿蝇的幼虫引起的。

[0053] 实施方案 24 : 实施方案 18 中的方法和用途, 其中所述动物为牛或羊。

[0054] 实施方案 25 : 实施方案 18-24 中任一项所述的方法或用途, 其中所述组合物包含选自溶剂和 / 或载体、乳化剂和 / 或分散剂的至少一种附加组分。

[0055] 实施方案 26 : 实施方案 25 中的方法或用途, 并且其中所述组合物包含至少一种附加的生物学活性化合物或试剂。

[0056] 实施方案 27 : 实施方案 26 中的方法或用途, 其中所述附加的生物学活性化合物或试剂选自大环内酯类、乙酰基胆碱酯酶抑制剂、节肢动物生长调节剂、GABA 门控氯通道拮抗剂、线粒体电子转运抑制剂、烟碱型乙酰胆碱激动剂 / 拮抗剂 / 活化剂、氧化磷酸化抑制剂、驱肠虫剂、钠通道调节剂或其他抗寄生物化合物。

[0057] 实施方案 28 : 实施方案 27 中的方法或用途, 其中所述生物学活性化合物为大环内酯类。

[0058] 实施方案 29 : 实施方案 27 中的方法或用途, 其中所述生物学活性化合物为选自有机磷酸酯和氨基甲酸酯的乙酰基胆碱酯酶抑制剂。

[0059] 实施方案 30 : 实施方案 27 中的方法或用途, 其中所述生物学活性化合物为节肢动物生长调节剂, 其选自甲壳质合成抑制剂、蜕皮激素激动剂 / 干扰素、脂质生物合成抑制剂和保幼激素模拟物。

[0060] 实施方案 31 : 实施方案 27 中的方法或用途, 其中所述生物学活性化合物为 GABA 门控氯通道拮抗剂。

[0061] 实施方案 32 : 权利要求 27 中的方法或用途, 其中所述生物学活性化合物为线粒体电子转运抑制剂。

[0062] 实施方案 33 : 权利要求 27 中的方法或用途, 其中所述生物学活性化合物为烟碱型乙酰胆碱激动剂 / 拮抗剂 / 活化剂。

[0063] 实施方案 34 : 权利要求 27 中的方法或用途, 其中所述生物学活性化合物为氧化磷酸化抑制剂。

[0064] 实施方案 35 : 权利要求 27 中的方法或用途, 其中所述生物学活性化合物为驱肠虫剂。

[0065] 上述实施方案旨在例证而不是限制。本发明的其他方面在整个说明书中予以论述。

[0066] 本发明还涉及通过向动物施用组合物来防治或预防叮咬飞蝇对所述动物侵染和 / 或治疗动物蝇蛆病的方法, 所述组合物包含杀寄生虫有效量的式 1 的化合物, 或其 N- 氧化物, 或药理学或兽医学可接受的盐。

[0067] 因此, 应当理解, 本发明包括发明概述中所述的用作动物药物、或更具体地讲用作抗蝇蛆病或杀飞蝇动物药物的化合物 (以及包含它们的组合物)。要保护的动物包括实施方案 4 和 5 中所述的那些。所述飞蝇包括实施方案 1、2 和 3 中所述的那些。所述药物可呈现为局部施用的形式。

[0068] 还应理解, 本发明包括在用于保护动物以防蝇蛆病或免受飞蝇攻击的药物生产中使用发明概述中所述的化合物。要保护的动物包括实施方案 4、5 和 24 中所述的那些。所述飞蝇包括实施方案 1-3 和 19-23 中所述的那些。所述药物可呈现为局部施用的形式。

[0069] 还应当理解, 本发明包括在用于保护动物以防蝇蛆病的药物生产中使用发明概述中所述的化合物。要保护的动物包括实施方案 4、5 和 24 中所述的那些。所述飞蝇包括实施方案 1-3 和 19-23 中所述的那些。所述药物可呈现为局部施用的形式。

[0070] 还应当理解, 本发明包括经包装并且呈现的用于防护动物蝇蛆病的发明概述中所述的化合物。要保护的动物包括实施方案 4、5 和 24 中所述的那些。所述飞蝇包括实施方案 1-3 和 19-23 中所述的那些。本发明的化合物可以包装并且呈现为局部施用剂型。

[0071] 还应理解, 本发明包括用于保护动物免受无脊椎寄生害虫侵害的组合物的制备方法, 所述方法的特征在于将式 1 的化合物与至少一种药理学或兽医学可接受的载体混合。要保护的动物包括实施方案 4、5 和 24 中所述的那些。所述飞蝇包括实施方案 1-3 和 19-23 中所述的那些。本发明的化合物可以包装并且呈现为局部施用剂型。

[0072] 根据本发明, 可使用的式 1 的化合物具有对叮咬飞蝇和丽蝇具有极好的抵抗功用, 同时可很好地被动物所耐受。因此本发明代表了对现有领域的真正补充。

[0073] 根据本发明的化合物具有良好的杀体外寄生虫活性, 同时对动物低毒性。

[0074] 可按照如世界专利申请公布 WO 03/015519 和美国专利 7, 232, 836 (在与本文公开内容一致的情况下, 所述文献以引用方式并入) 中所述的一种或多种方法及其变型来制备式 1 的化合物。用于制备杂环和叔胺 N- 氧化物的合成方法是本领域的技术人员熟知的, 包括使用过氧酸诸如过氧乙酸和间氯过氧苯甲酸 (MCPBA)、过氧化氢、烷基氢过氧

化物诸如叔丁基氢过氧化物、过硼酸钠和双环氧乙烷诸如二甲基双环氧乙烷来氧化杂环和叔胺。用于制备 N-氧化物的这些方法已被广泛描述和综述于以下文献中,参见例如:T.L.Gilchrist 的 Comprehensive Organic Synthesis 第 7 卷 第 748-750 页, S.V.Ley 编辑, Pergamon Press); M.Tisler 和 B.Stanovnik 的 Comprehensive Heterocyclic Chemistry 第 3 卷 第 18-20 页, A.J.Boulton 和 A.McKillop 编辑, Pergamon Press); M.R.Grimmett 和 B.R.T.Keene 的 Advances in Heterocyclic Chemistry 第 43 卷 第 149-161 页, A.R.Katritzky 编辑, Academic Press); M.Tisler 和 B.Stanovnik 的 Advances in Heterocyclic Chemistry 第 9 卷 第 285-291 页, A.R.Katritzky 和 A.J.Boulton 编辑, Academic Press); 以及 G.W.H.Cheeseman 和 E.S.G.Werstiuk 的 Advances in Heterocyclic Chemistry 第 22 卷 第 390-392 页, A.R.Katritzky 和 A.J.Boulton 编, Academic Press)。

[0075] 也可设想到适于施用模式的药物学或兽医学可接受的盐。

[0076] 本文所述发明涉及通过向动物施用杀寄生物有效量的式 1 的化合物来防治或预防飞蝇对所述动物侵染的方法。

[0077] 由于式 1 的化合物既是有效的杀成虫剂又是杀幼虫剂,即,由于它们对目标寄生物的成虫期和所述寄生物的幼虫期均有效,因此它们在治疗蝇蛆病方面是尤其有利的。

[0078] 本发明的化合物的施用

[0079] 本发明的式 1 的化合物可施用于任何动物,包括受飞蝇侵扰或受蝇蛆病困扰的成群动物。可将所述组合物施用于例如牛、绵羊、山羊、马、驴、骆驼、猪、驯鹿、北美驯鹿和野牛。还可对人进行治疗。

[0080] 作为非限制性实例,可以下列方式实现“施用”:包含由式 1 的化合物组成的化合物和组合物的动物全身喷剂、自施用装置、浇淋处理剂和受控剥离装置诸如耳标和带材、颈圈、耳标、尾带、肢带或笼头。除了喷剂和浇淋处理剂以外,施用还可经由其他形式的局部给药,例如浸入或浸渍形式、洗涤形式、用粉末涂布形式、或施用到动物体小区域上的形式。

[0081] 通常可经由溶液、乳液、悬浮液、兽用顿服药、粉末和浇淋处理剂,以向要治疗的动物施用根据本发明的组合物。

[0082] 浇淋或点滴方法包括向动物皮肤或皮毛的指定区域,优选向颈部和脊背施用式 1 的化合物。这可通过例如将浇淋或点滴型制剂拭抹或喷涂到皮毛的较小区域上,由于制剂内组分的扩散性并且在动物活动的辅助下,活性物质从此处几乎自动分散到大面积皮毛上来进行。

[0083] 可通过将式 1 的化合物施用到动物居住的局部环境中(诸如垫草、围栏等)来将其间接施用于动物。

[0084] 动物全身喷剂可快速减轻飞虫的影响。通常在高压下将动物喷剂作为稀释的粗糙喷雾施用以渗透皮肤,或将动物喷剂作为更浓缩的微细小体积薄雾施用。

[0085] 自施用装置包括用被杀昆虫剂油溶液处理的吸收材料涂布的背部橡胶,或填充杀虫粉剂的抖粉袋。背部橡胶和抖粉袋应被放置在接近水源和饲料源的出入口,以及动物将频繁接触它们的区域中。

[0086] 受控释放耳标和带材一般可非常有效地控制某些农场区域内的飞虫。

[0087] 浇淋处理剂涉及沿着动物的背线以处方剂量的局部用产品施用杀昆虫剂。在用更

加劳动密集给药方法治疗所有动物是困难或耗时的情况下, 浇淋或点滴方法可尤其有利地用于成群动物, 诸如牛、马、绵羊或猪。

[0088] 根据本发明的化合物可尤其有效地抵抗飞蝇幼虫。优选通过由皮肤或局部使用以已知的方式例如以浸渍、喷雾、浇淋和点滴以及涂粉形式来使用所述活性化合物。

[0089] 丽蝇叮咬几乎总是致命的, 除非将羊抓住, 修剪受感染区域的羊毛, 将蛆刮出, 施用消毒剂或抗生素以及杀昆虫剂以预防进一步叮咬。处理丽蝇叮咬将有助于杀灭任何存在的蛆, 预防飞蝇进一步叮咬的可能, 并且有助于伤口愈合。应将伤口和周围区域附近的羊毛小心地剪去。将包含式 1 的化合物的霜膏施用到受感染区域上。在正确的处理下, 不严重的病例将很快治愈。

[0090] 通过浸渍也可有效地处理患蝇蛆病的羊或有被感染风险的那些羊。尤其重要的是, 将羊浸泡至少整整一分钟, 以确保浸料将所有羊毛饱和, 并且定期补充浸浴, 这对于保持浸料浓缩液强度而言是重要的。浇淋剂也是有效的处理剂。

[0091] 本发明的组合物

[0092] 可单独施用本发明的化合物, 但是通常将其配入到兽药或医药组合物中。可以已知的方式将所述化合物配制或配入到组合物中, 例如如果适宜的话, 使用乳化剂和 / 或分散剂, 将活性化合物与溶剂和 / 或载体一起挤出; 如果例如用水作为稀释剂, 则有机溶剂可用作助溶剂 (如果适宜的话)。

[0093] 通常用于本发明中的组合物包含式 1 的化合物、其 N-氧化物或盐与一种或多种药理学或兽医学可接受的载体的混合物, 所述载体包含赋形剂和助剂, 其根据它们用于局部施用的适宜性以及根据标准操作来选择。此外, 根据与所述组合物中一种或多种活性成分的相容性, 包括诸如对 pH 和含水量的相对稳定性的考虑, 来选择适宜的载体。典型的施用介质是用于保护动物免受无脊椎寄生害虫侵害的组合物, 所述组合物包含杀寄生物有效量的式 1 的化合物和至少一种载体。

[0094] 用于局部给药的制剂通常为粉末、霜膏、悬浮液、喷雾剂、乳液、泡沫、糊剂、气溶胶、油膏剂、软膏或凝胶形式。局部用制剂更典型为水溶性溶液, 其可为使用前稀释的浓缩物形式。适于局部给药的杀寄生物组合物通常包含本发明的化合物和一种或多种局部用适宜载体。在将杀寄生物组合物以线或点的形式 (即准确疗法) 局部施用到动物体外部时, 活性成分在动物体表上迁移, 以覆盖其大部分或所有的外表面积。因此, 被治疗的动物可尤其对从动物表皮取食的无脊椎害虫诸如壁虱、跳蚤和虱子免疫。因此, 用于局部给药的制剂通常包含至少一种有机溶剂, 以有利于活性成分在动物皮肤上传递和 / 或渗透到动物表皮中。此类制剂中的载体包括丙二醇、石蜡、芳族化合物、酯 (诸如肉豆蔻酸异丙酯)、乙二醇醚、醇 (诸如乙醇、正丙醇、2-辛基十二烷醇或油醇); 一羧酸酯的溶液, 诸如肉豆蔻酸异丙酯、棕榈酸异丙酯、月桂酸草酸酯、油酸油基酯、油酸癸酯、月桂酸己酯、油酸油基酯、油酸癸酯、链长 C_{12} - C_{18} 的饱和脂肪醇的己酸酯; 二羧酸酯的溶液, 诸如邻苯二甲酸二丁酯、间苯二甲酸二异丙酯、己二酸二异丙酯、己二酸二正丁酯, 或脂族酸的 (例如乙二醇) 酯溶液。存在药物或化妆品工业已知的结晶抑制剂或分散剂也可能是有利的。

[0095] 还可配制浇淋制剂以防治具有农业价值动物的寄生物。本发明的浇淋制剂可为液体、粉末、乳液、泡沫、糊剂、气溶胶、油膏剂、软膏或凝胶形式。浇淋制剂通常为液体。这些浇淋制剂可有效地施用于绵羊、牛、山羊、其他反刍动物、骆驼科哺乳动物、猪和马。通常通

过将浇淋制剂以一条或多条细线的形式,或准确浇淋在动物背部中线(背部)或肩部来施用所述浇淋制剂。更典型通过将所述制剂沿着动物背部,顺着脊椎浇淋来施用。还可经由其他常规方法来施用所述制剂,包括用浸渍过的材料在动物的至少一小块面积上擦拭,或者使用可商购获得的施用装置来将其施用,通过注射器施用,通过喷雾施用或通过使用喷雾栅栏过道来施用。浇淋制剂包括载体,并且还可包含一种或多种附加成分。适宜的附加成分的实例是稳定剂诸如抗氧化剂、铺展剂、防腐剂、粘附促进剂、活性增溶剂诸如油酸、粘度调节剂、紫外线阻隔剂或吸收剂、以及着色剂。表面活性剂也可包含于这些制剂中,包括阴离子、阳离子、非离子和两性表面活性剂。

[0096] 本发明的制剂通常包含抗氧化剂,诸如 BHT(丁基化羟基甲苯)。所述抗氧化剂的含量一般为 0.1-5%(重量/体积)。某些制剂需要增溶剂诸如油酸以溶解活性剂。用于这些浇淋制剂中的常见铺展剂是:IPM、IPP、饱和 C_{12} - C_{18} 脂肪醇的辛酸/癸酸酯、油酸、油醇酯、油酸乙酯、甘油三酯、硅油和 DPM。可根据已知的技术来制备本发明的浇淋制剂。当浇淋剂为溶液时,采用加热和搅拌(如果需要),将“杀寄生物剂”/杀昆虫剂与载体或媒介物混合。可将辅助或附加成分加入到活性剂和载体的混合物中,或者在加入载体前将它们与活性剂混合。如果浇淋剂为乳液或悬浮液,则可类似地采用已知技术来制备这些制剂。

[0097] 可使用用于较疏水的药物化合物的其他递送体系。脂质体和乳液是用于疏水性药物的熟知递送媒介物或载体的实例。此外,可使用有机溶剂诸如二甲基亚砷。

[0098] 式 1 的化合物在所述组合物中的浓度含量一般为 0.1 至 95 重量%,优选 0.5 至 90 重量%。旨在直接施用的制剂包含根据本发明的活性化合物,其浓度介于 0.001 和 5 重量%之间,优选 0.005 至 3 重量%。

[0099] 剂量可在 0.0001mg 式 1 的化合物/kg 动物体重至约 1000mg 式 1 的化合物/kg 动物体重的范围内。有时剂量可为 0.1mg/kg 动物体重至约 200mg/kg。约 0.01 至约 100mg/kg 或 0.02 至约 50mg/kg 的给药量常常是有利的,并且在很多情况下介于 0.1 和 75mg/kg 之间。优选实施处理,使得向动物施用 0.1 至 40mg/kg,具体地讲 1 至 30mg/kg 的剂量。可以单剂量形式或定时间歇形式进行给药,并且可每天一次、每周一次、每月一次、两月一次或一季一次进行给药,以获得有效的效果。

[0100] 然而有时需要背离上述量,并且具体地讲,根据测试动物体重和/或施用方法,并且根据动物种类以及其对药物的独特行为,或后一种制剂的特性以及其所施用的时间或间隔来进行。因此在某些情况下,在低于上述最小量下实施处理是足够的,而在其他情况下,必须超出所述上限。当大量施用时,建议在一天之间,将这些分成若干次的单独给药。上文所作其他陈述的一般含义也是适用的。

[0101] 浇淋或点滴制剂适宜地包含载体,所述载体可促使其在宿主动物皮肤表面上或皮毛中快速分散,并且一般被视为扩散油。适宜的载体例如:油性溶液;醇和异丙醇溶液,诸如 2-辛基十二烷醇或油醇的溶液;一羧酸酯的溶液,诸如肉豆蔻酸异丙酯、棕榈酸异丙酯、月桂酸草酸酯、油酸油基酯、油酸癸酯、月桂酸己酯、油酸油基酯、油酸癸酯、链长 C. sub. 12-C. sub. 18 的饱和脂肪醇的癸酸酯;二羧酸酯的溶液,诸如邻苯二甲酸二丁酯、间苯二甲酸二异丙酯、己二酸二异丙酯、己二酸二正丁酯,或脂族酸的(例如乙二醇)酯溶液。另外存在分散剂是有利的,诸如药物或化妆品工业已知的分散剂。实例为 2-吡咯烷酮、2-(N-烷基)吡咯烷酮、丙酮、聚乙二醇以及它们的醚和酯,丙二醇或合成甘油三酯。

[0102] 所述油性溶液包括例如植物油诸如橄榄油、花生油、芝麻油、松油、亚麻籽油或蓖麻油。所述植物油还可以环氧化形式存在。还可使用石蜡和硅油。

[0103] 浇淋或点滴制剂一般包含按重量计 1 至 20% 的式 1 的化合物, 按重量计 0.1 至 50% 的分散剂和按重量计 45 至 98.9% 的溶剂。

[0104] 重要的是, 可通过将式 1 的化合物施用到动物居住的局部环境中 (诸如垫草、围栏等) 来将其间接地施用于动物。有效用量将在约 1.0 至 50mg 每平方米的范围内, 但是低至 0.1mg 每平方米的施用量可能也是足够的, 或者高达 150mg 每平方米的施用量可能也是需要的。本领域的技术人员易于确定为达到期望的害虫防治度所需的生物学有效量。

[0105] 本发明的方法可包括施用附加的活性化合物:

[0106] 预期可同时或不同时施用附加的生物学活性化合物, 以获得更广谱的害虫防治效果或攻击成年跳蚤。此类附加的生物学活性化合物可与式 1 的化合物包装在一起作为套盒。为方便起见, 可将此类附加生物学活性化合物配入到包含式 1 的化合物的同一组合物中。因此, 本发明设想使用组合物的特征在于除了式 1 的化合物以外, 它们包含其他助剂和 / 或活性化合物, 诸如附加生物学活性化合物, 除了惯用的固体或液体增量剂、稀释剂和 / 或表面活性剂以外, 还可将消毒剂或抗生素混入到所述制剂中, 或即用型溶液中。

[0107] 值得注意的是附加的生物学活性化合物或试剂, 其选自本领域已知的驱肠虫剂, 诸如阿维菌素 (例如伊维菌素、莫西菌素、米尔倍霉素)、苯并咪唑 (例如阿苯达唑、三氯苯咪唑)、N- 水杨酰苯胺 (例如氯生太尔、羟氯扎胺)、取代的苯酚 (例如硝羟碘苄腈)、嘧啶 (例如噻嘧啶)、咪唑噻唑 (例如左咪唑) 和吡啶酮。

[0108] 可用于本发明的组合物中的其他生物学活性化合物或试剂可选自昆虫生长调节剂 (IGR) 和保幼激素类似物 (JHA), 诸如除虫脲、杀虫脲、氟佐隆、赛灭净、甲氧普烯等, 从而向动物对象以及动物对象的环境提供对寄生物的初始和持续防治 (在昆虫生长的所有阶段, 包括卵)。

[0109] 根据本发明的式 I 的化合物可单独使用, 或与其他生物杀灭剂组合使用。它们可与具有相同活性范围的杀虫剂组合以例如增加活性, 或与具有另一活性范围的物质组合以例如扩展活性范围。加入所谓的拒斥剂也是适宜的。如果期望将活性范围扩展至体内寄生虫例如驱虫剂, 则可使式 1 的化合物适宜地与具有杀体内寄生虫特性的物质组合。当然, 它们还可与抗菌组合物联合使用。

[0110] 组合配对的优选组尤其是优选的组合配对优选组描述于下文中, 其中除了式 1 的化合物以外, 组合还可包含这些配对中的一种或多种。

[0111] 混合物中适宜的配对可以是生物杀灭剂, 例如具有不同作用机理的杀昆虫剂和杀螨剂, 它们描述于下文中并且是本领域技术人员一直已知的, 例如甲壳质合成抑制剂、生长调节剂; 用作保幼激素的活性成分; 用作杀成虫剂的活性成分; 广谱杀昆虫剂、广谱杀螨剂和杀线虫剂; 以及熟知的驱肠虫剂和抑制昆虫和 / 或螨虫的物质, 以及拒斥剂或解离剂。

[0112] 此类生物学活性化合物的实例包括但不限于下列这些: 有机磷酸酯, 其是一般已知为乙酰基胆碱酯酶抑制剂的一类物质: 高灭磷、甲基吡啶磷、谷硫磷 - 乙基、谷硫磷 - 甲基、溴硫磷、溴硫磷 - 乙基、硫线磷、四氯乙磷、氯吡硫磷、毒虫畏、氯甲磷、内吸磷、内吸磷 - S- 甲基、内吸磷 - S- 甲基砒、氯亚磷、敌匹硫磷、敌敌畏、百治磷、乐果、乙拌磷、乙硫磷、丙线磷、乙嘧硫磷、氨磺磷、苯线磷、杀螟松、丰索磷、倍硫磷、吡氟硫磷、地虫磷、安果、噻唑

磷、蚜磷、氯唑磷、异丙磷、异噁唑磷、马拉硫磷、虫螨畏、甲胺磷、杀扑磷、甲基 - 对硫磷、速灭磷、久效磷、二溴磷、氧化乐果、砒吸磷 - 甲基、对氧磷、对硫磷、对硫磷 - 甲基、稻丰散、伏杀硫磷、棉安磷、phosphocarb、亚胺硫磷、磷胺、甲拌磷、腈肟磷、噻啉磷、噻啉磷 - 甲基、丙溴磷、丙虫磷、胺丙畏、丙硫磷、吡啉硫磷、哒嗪硫磷、啉硫磷、硫灭克磷、双硫磷、特丁磷、丁基噻啉磷、杀虫畏、甲基乙拌磷、三唑磷、敌百虫、蚜灭多。

[0113] 氨基甲酸酯,其是一般已知为乙酰基胆碱酯酶抑制剂的一类物质:棉铃成、涕灭威、2- 仲丁基苯基氨基甲酸甲酯、丙硫克百威、西维因、克百威、呋喃威、地虫威、乙硫苯威、苯氧威、苯硫威、呋线威、HCN-801、异丙威、茚虫威、灭虫威、乙肟威、5- 甲基间异丙苯基丁酰氨基甲酸甲酯、草氨酯、抗蚜威、残杀威、硫双灭多威、特氨叉威、啉蚜威、UC-51717;拟除虫菊酯,其是一般已知为钠通道调节剂的一类物质:氟丙菊酯、丙烯菊酯、 α - 氯氰菊酯、(E)-(1R)- 顺式 -2,2- 二甲基 -3-(2- 氧硫杂环戊烷 -3- 亚基甲基) 环丙烷甲酸 5- 苄基 -3- 呋喃基甲酯、联苯菊酯、8- 氟氯氰菊酯、氟氯氰菊酯、oc- 氯氰菊酯、8- 氯氰菊酯、生物烯丙菊酯、生物烯丙菊酯 ((S)-I 环戊基异构体)、灭虫菊、联苯菊酯、NCI-85193、乙氰菊酯、三氟氯氰菊酯、cythithrin、苯醚氰菊酯、溴氢菊酯、右旋烯炔菊酯、顺式氰戊菊酯、醚菊酯、芬氟司林、甲氰菊酯、腈苯苯醚菊酯、氟氰戊菊酯、氟氯苯菊酯、氟胺氰菊酯 (D 异构体)、炔醚菊酯、三氟氯氰菊酯、\ - 三氟氯氰菊酯、扑灭司林、苯氧司林、右旋丙炔菊酯、除虫菊酯 (天然产物)、灭虫菊、似虫菊、四氟苯菊酯、 θ - 氯氰菊酯、氟硅菊酯、T- 氟胺氰菊酯、七氟菊酯、四溴菊酯、 ζ - 氯氰菊酯。

[0114] 节肢动物生长调节剂包括:a) 甲壳质合成抑制剂:苯甲酰胺:定虫隆、除虫脲、氟佐隆、氟环脲、氟虫脲、氟铃脲、虱螨脲、双苯氟脲、伏虫脲、杀虫脲、扑虱灵、二苯丙醚、噻螨酮、乙螨唑、chlorfentazine;b) 蜕皮激素激动剂/干扰素:氯虫酰胺、甲氧虫酰胺、虫酰胺;c) 保幼激素模拟物:蚊蝇醚、甲氧普烯、苯氧威;d) 脂质生物合成抑制剂:季酮螨酯。其他抗寄生虫剂:灭螨醌、双甲脒、AKD-1022、ANS-118、印楝素、苏云金芽孢杆菌、杀虫磺、联苯脒酯、乐杀螨、溴螨酯、BTG-504、I BTG-505、毒杀芬、杀螟丹、克氯苯、杀虫脒、溴虫腈、可芬诺、可尼丁、赛灭净、diaclofen、丁醚脒、DBI-3204、二活菌素、二羟基甲基二羟基吡咯烷、敌螨通、消螨普、硫丹、乙虫腈、醚菊酯、啉螨啉、氟螨啉、MTI-800、啉螨啉、啉螨啉、氟苯亚胺噻唑、溴氟菊酯、氟螨啉、三氟醚菊酯、扫螨宝、苄螨啉、伏蚁脒、IKI-220、kanemite、NC-196、neem guard、nidinortofuran、烯啉虫胺、SD-35651、WL-108477、pyridaryl、克螨特、protrifenbutate、吡蚜酮、啉螨啉、啉螨啉、NC-1111、R-195、RH-0345、RH-2485、RYI-210、S-1283、S-1833、SI-8601、氟硅菊酯、silomadine、多杀菌素、吡啉胺、四氯杀螨砒、四抗菌素、噻虫啉、杀虫环、噻虫啉、啉虫酰胺、啉蚜威、三乙多杀菌素、三活菌素、增效炔醚、vertalec、YI-5301 杀真菌剂:苯并噻二唑、杀螟丹、1- 氨基丙基磷酸、胺扑灭、戊环唑、啉菌酯、苯霜灵、苯菌灵、双丙氨磷、杀稻瘟菌素 -S、波尔多液、糠菌唑、乙啉酚磺酸酯、环丙酰菌胺、敌菌丹、克菌丹、卡苯达唑、2-(2- 氯苯基)-1H- 苯并咪唑、地茂散、三氯硝基甲烷、百菌清、乙菌利、王铜、铜盐、环氟菌胺、霜脲氰、环唑醇、啉菌环胺、酯菌胺、RH-7281、双氯氰菌胺、苄氯三唑醇、啉菌清、氯硝胺、苯醚甲环唑、RP-407213、烯啉吗啉、醚菌胺、烯唑醇、烯唑醇 -M、多果定、敌瘟磷、氟环唑、噁唑菌酮、咪唑菌酮、氯苯啉啉醇、腈苯唑、缬霉威、拌种咯、苯锈啉、丁苯吗啉、薯瘟锡、氟啉胺、咯菌腈、氟啉胺、氟吗啉/ 氟吗啉、三苯基氢氧化锡、氟啉酯、氟啉唑、氟硅唑、氟酰胺、粉唑醇、灭菌丹、藻菌磷、呋霜灵、呋吡菌胺、己唑醇、

种菌唑、异稻瘟净、扑海因、稻瘟灵、春日霉素、苯氧菌酯、代森锰锌、代森锰、精甲霜灵、担菌宁、甲霜灵、叶菌唑、苯氧菌胺 / 苯氧菌胺、苯菌酮、腈菌唑、甲肿铁铵、啉酰菌胺、醚菌胺、恶霜灵、戊菌唑、戊菌隆、烯丙异噻唑、咪鲜胺、霜霉威、丙环唑、丙氧喹啉、丙硫菌唑、啉斑肟、唑菌胺酯、嘧霉胺、咯啉酮、快诺芬、螺环菌胺、硫、戊唑醇、氟醚唑、噻菌灵、噻呋灭、甲基硫菌灵、二硫四甲秋兰姆、噻酰菌胺、三唑酮、三唑醇、三环唑、肟菌酯、灭菌唑、井冈霉素, 乙烯菌核利生物制剂; 苏云金芽孢杆菌亚莎华亚种、库尔斯塔克、苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素、杆状病毒、昆虫致病细菌, 病毒和真菌杀菌剂; 氯四环素、氧四环素、链霉素。

[0115] 配对杀昆虫剂和杀螨剂的其他更具体实例列于下文中:

[0116] 化合物 类别

[0117]

阿巴美丁	大环内酯类
AC 303 630	能量产生调节剂
高灭磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
氟丙菊酯	钠通道调节剂
棉铃成	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
涕灭威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
α - 氯氰菊酯	钠通道调节剂
顺式氯氰菊酯	钠通道调节剂
双甲脒	章鱼胺受体配体
阿维菌素	大环内酯类
谷硫磷 A	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
谷硫磷 M	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
谷硫磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
三唑锡	氧化磷酸化抑制剂
枯草杆菌毒素	
恶虫威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂

阿巴美丁	大环内酯类
丙硫克百威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
杀虫磺	烟碱型乙酰胆碱激动剂 / 拮抗剂
β -氟氯氰菊酯	钠通道调节剂
联苯菊酯	钠通道调节剂
苳螨醚	钠通道调节剂
溴硫磷 A	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
丁苯氨酯	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
扑虱灵	甲壳质合成抑制剂
丁酮威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
硫线磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
西维因	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
克百威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
三硫磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
杀螟丹	烟碱型乙酰胆碱激动剂 / 拮抗剂
地虫威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
四氯乙磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
溴虫腈	氧化磷酸化抑制剂
定虫隆	甲壳质合成抑制剂
氯甲磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
氯蜚硫磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂

阿巴美丁	大环内酯类
顺式 - 灭虫菊	钠通道调节剂
螨死净	
杀螟腈	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
乙氰菊酯	钠通道调节剂
氟氯氰菊酯	钠通道调节剂
三环锡	氧化磷酸化抑制剂
D2341 (联苯肼酯)	
溴氢菊酯	钠通道调节剂
内吸磷 M	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
内吸磷 S	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
内吸磷 -S- 甲基	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
除线磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
Dicliphos	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
乙硫磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
除虫脲	甲壳质合成抑制剂
乐果	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
敌敌钙	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
敌杀磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
多拉菌素	大环内酯类
DPX-MP062 (茚虫威)	钠通道调节剂

阿巴美丁	大环内酯类
敌瘟磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
甲氨基阿维菌素	大环内酯类
硫丹	gaba- 门控氯通道拮抗剂
依立诺克丁	大环内酯类
顺式氰戊菊酯	钠通道调节剂
乙硫苯威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
乙硫磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
醚菊酯	钠通道调节剂
灭线磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
乙嘧硫磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
苯线磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
喹螨醚	线粒体电子转运抑制剂
苯丁锡	氧化磷酸化抑制剂
杀螟松	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
仲丁威 (BPMC)	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
苯硫威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
苯氧威	保幼激素模拟物
甲氰菊酯	钠通道调节剂
吡螨胺	线粒体电子转运抑制剂
唑螨酯	线粒体电子转运抑制剂

阿巴美丁	大环内酯类
倍硫磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
腈苯苯醚菊酯	钠通道调节剂
氟虫腈	gaba- 门控氯通道拮抗剂
氟啶胺	氧化磷酸化解联剂
氟佐隆	甲壳质合成抑制剂
氟环脲	甲壳质合成抑制剂
氟氰戊菊酯	钠通道调节剂
氟虫脲	甲壳质合成抑制剂
三氟醚菊酯	钠通道调节剂
大福松	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
安果	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
噻唑磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
HCH	gaba- 门控氯通道拮抗剂
蚜螨磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
氟铃脲	甲壳质合成抑制剂
噻螨酮	
烯虫乙酯	保幼激素模拟物
吡虫啉	烟碱型乙酰胆碱激动剂 / 拮抗剂
昆虫活性真菌	
昆虫活性线虫	

阿巴美丁	大环内酯类
昆虫活性病毒	
异稻瘟净	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
异柳磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
异丙威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
异噁唑磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
伊维菌素	氯通道活化剂
高三氟氯氰菊酯	钠通道调节剂
虱螨脲	甲壳质合成抑制剂
马拉硫磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
灭蚜磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
Mesulfenphos	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
蜗牛敌	
甲胺磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
灭虫威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
乙肟威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
甲氧普烯	保幼激素模拟物
速灭威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
速灭磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
密灭汀	大环内酯类
莫西菌素	大环内酯类

阿巴美丁	大环内酯类
二溴磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
NI-25, 啉虫脒	烟碱型乙酰胆碱激动剂 / 拮抗剂
烯啉虫胺	烟碱型乙酰胆碱激动剂 / 拮抗剂
Nodulisporic 酸 / 衍生物	大环内酯类
氧化乐果	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
草氨酰	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
砒吸磷 M	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
异亚砒磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
对硫磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
对硫磷 - 甲基	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
扑灭司林	钠通道调节剂
稻丰散	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
甲拌磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
伏杀硫磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
亚胺硫磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
腈肟磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
抗蚜威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
噻啉磷 A	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
噻啉磷 M	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
猛杀威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂

阿巴美丁	大环内酯类
丙虫磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
残杀威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
丙硫磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
发果	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
Pyrachlophos	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
哒嗪硫磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
Pyresmethrin	钠通道调节剂
除虫菊	钠通道调节剂
哒螨酮	线粒体电子转运抑制剂
嘧螨醚	线粒体电子转运抑制剂
蚊蝇醚	保幼激素模拟物
RH 5992	蜕皮激素激动剂
RH-2485	蜕皮激素激动剂
蔬果磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
塞拉菌素	大环内酯类
氟硅菊酯	钠通道调节剂
多杀菌素	烟碱型乙酰胆碱活化剂
硫特普	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
硫丙磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
虫酰肼	蜕皮激素激动剂

阿巴美丁	大环内酯类
吡螨胺	线粒体电子转运抑制剂
噁丙磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
伏虫脲	甲壳质合成抑制剂
七氟菊酯	钠通道调节剂
双硫磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
特丁磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
杀虫畏	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
Thiafenox	
硫双灭多威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
特氨叉威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
硫磷嗪	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
苏云金素	
四溴菊酯	钠通道调节剂
Triarathen	
唑蚜威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
三唑磷	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
敌百虫	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
杀虫脲	甲壳质合成抑制剂
混杀威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
蚜灭多	乙酰基胆碱酯酶抑制剂

阿巴美丁	大环内酯类
XMC (3,5-二甲苯基氨基甲酸甲酯)	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
灭杀威	乙酰基胆碱酯酶抑制剂
YI 5301/5302	
ζ.-氯氰菊酯	钠通道调节剂
高效氯氰菊酯	钠通道调节剂

[0118]

[0119]

[0120]

[0121]

[0122]

[0123] 适宜的驱肠虫剂的非限制实例如下所述,一些代表性物质除了驱肠虫活性以外,还具有杀虫和杀螨活性,并且已部分列于上表中。

[0124] (A1) 吡喹酮 = 2-环己基羰基-4-氧代-1,2,3,6,7,11b-六氢-4H-吡嗪并[2,1-α.]异喹啉

[0125] (A2) 氯生太尔 = 3,5-二碘-N-[5-氯-2-甲基-4-(α-氰基-4-氯苄基)苯基]-水杨酰胺

[0126] (A3) 三氯苯咪唑 = 5-氯-6-(2,3-二氯苯氧基)-2-甲硫基-1H-苯并咪唑

[0127] (A4) 左旋咪唑 = L-(-)-2,3,5,6-四氢-6-苯基咪唑并[2,1b]噻唑

[0128] (A5) 甲苯咪唑 = (5-苯甲酰基-1H-苯并咪唑-2-基)氨基甲酸甲酯

[0129] (A6) 脐菇亭 = 描述于 WO 97/20857 中的真菌发光类脐菇的大环发酵产物

[0130] (A7) 阿巴美丁 = 阿维菌素 B1

[0131] (A8) 伊维菌素 = 22,23-二氢除虫菌素 B1

[0132] (A9) 莫西菌素 = 5-O-去甲基-28-脱氧-25-(1,3-二甲基-1-丁烯基)-6-,28-环氧-23-(甲氧基亚氨基)-米尔倍霉素 B

[0133] (A10) 多拉菌素 = 25-环己基-5-O-去甲基-25-脱(1-甲基丙基)-阿维菌素 A1a

[0134] (A11) 密灭汀 = 米尔倍霉素 A3 和米尔倍霉素 A4 的混合物

[0135] (A12) 米尔贝肟 = 密灭汀的 5-肟

[0136] 适宜的拒斥剂和解离剂的非限制性实例为:

[0137] (R1) DEET (N,N-二乙基间甲苯甲酰胺)

[0138] (R2) KBR 3023N-丁基-2-氧羰基-(2-羟基)-哌啶

[0139] (R3) 赛米唑 = N,-2,3-二氢-3-甲基-1,3-噻唑-2-亚基-2,4-二甲苯胺

[0140] 混合物中的上述配对是该领域专业人员所熟知的。大多数描述于各种版本的

“Pesticide Manual”(The British Crop Protection Council,London)中,其他描述于各种版本的“The Merck Index”(Merck & Co., Inc., Rahway, N. J., USA)或专利文献中。因此,下列列表限于可以举例的方式查到它们的若干出处。

[0141] (I)2-甲基-2-(甲硫基)丙醛-0-甲基氨基甲酰肼(涕灭威),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British Crop Protection Council,London,第26页);

[0142] (II)S-(3,4-二氢-4-氧苯并[d]-[1,2,3]-三嗪-3-基甲基)0,0-二甲基二硫代磷酸酯(谷硫磷),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British Crop Protection Council,London,第67页);

[0143] (III)N-[2,3-二氢-2,2-二甲基苯并呋喃-7-基氧羰基-(-甲基)氨硫基]-N-异丙基-β-丙氨酸乙酯(丙硫克百威),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British Crop Protection Council,London,第96页);

[0144] (IV)2-甲基联苯-3-基甲基-(Z)-(1RS)-顺式-3-(2-氯-3,3,3-三氟丙-1-烯基)-2,2-二甲基环丙烷甲酸酯(联苯菊酯),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British Crop Protection Council,London,第118页);

[0145] (V)2-叔丁基亚氨基-3-异丙基-5-苯基-1,3,5-噻二嗪-4-酮(扑虱灵),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British Crop Protection Council,London,第157页);

[0146] (VI)2,3-二氢-2,2-二甲基苯并呋喃-7-基-氨基甲酸甲酯(克百威),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British Crop Protection Council,London,第186页);

[0147] (VII)2,3-二氢-2,2-二甲基苯并呋喃-7-基-(二丁基氨硫基)氨基甲酸甲酯(呋喃威),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British Crop Protection Council,London,第188页);

[0148] (VIII)S,S'-(2-二甲胺基-1,3-丙烷二基)-双(硫代氨基甲酸酯)(杀螟丹),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British Crop Protection Council,London,第193页);

[0149] (IX)1-[3,5-二氯-4-(3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶氧基)苯基]-3-(2,6-二氟苯甲酰)脲(定虫隆),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British Crop Protection Council,London,第213页)

[0150] (X)0,0-二乙基-0-3,5,6-三氯-2-吡啶基硫代磷酸(氯蜚硫磷),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British Crop Protection Council,London,第235页);

[0151] (XI)(RS)-α-氰基-4-氟-3-苯氧基苄基-(1RS,3RS;1RS,3RS)-3-(2,2-二氯乙基)-2,2-二甲基环丙烷甲酸酯(氟氯氰菊酯),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British Crop Protection Council,London,第293页);

[0152] (XI I)(S)-α-氰基-3-苯氧基苄基-(Z)-(1R,3R)-3-(2-氯-3,3,3-三氟丙基)-2,2-二甲基环丙烷甲酸酯和(R)-α-氰基-3-苯氧基苄基-(Z)-(1R,3R)-3-(2-氯-3,3,3-三氟丙基)-2,2-二甲基环丙烷甲酸酯的混合物(高三氟氯氰菊

酯),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British Crop Protection Council,London,第300页);

[0153] (XIII)由(S)- α -氰基-3-苯氧基苄基-(2)-(1R,3R)-3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基环丙烷甲酸酯和(R)- α -氰基-3-苯氧基苄基-(1S,3S)-3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基环丙烷甲酸酯组成的外消旋物(α -氯氰菊酯),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The BritishCrop Protection Council,London,第308页);

[0154] (XIV)(S)- α -氰基-3-苯氧基苄基(1RS,3RS,1RS,3RS)-3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基环丙烷甲酸酯的立体异构体的混合物(ζ -氯氰菊酯),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The BritishCrop Protection Council,London,第314页);

[0155] (XV)(S)- α -氰基-3-苯氧基苄基-(1R,3R)-3-(2,2-二溴乙烯基)-2,2-二甲基环丙烷甲酸酯(溴氢菊酯),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British Crop Protection Council,London,第344页);

[0156] (XVI)(4-氯苯基)-3-(2,6-二氟苯甲酰)脲(除虫脲),出自“ThePesticide Manual”第11版(1997年,The British Crop ProtectionCouncil,London,第395页);

[0157] (XVII)(1,4,5,6,7,7-六氯-8,9,10-三降冰片-5-烯-2,3-亚基双亚甲基)-亚硫酸盐(硫丹),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British Crop Protection Council,London,第459页);

[0158] (XVIII). α -乙硫基-o-甲苯基-氨基甲酸甲酯(乙硫苯威),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British CropProtection Council,London,第479页);

[0159] (XIX)0,0-二甲基-0-4-硝基间甲苯基硫代磷酸(杀螟松),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British CropProtection Council,London,第514页);

[0160] (XX)2-仲丁基苯基氨基甲酸甲酯(仲丁威),出自“The PesticideManual”第11版(1997年,The British Crop Protection Council,London,第516页);

[0161] (XXI)(RS)- α -氰基-3-苯氧基苄基-(RS)-2-(4-氯苯基)-3-甲基丁酸酯(腈苯苯醚菊酯),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British Crop Protection Council,London,第539页);

[0162] (XXII)S-[甲酰基(甲基)氨基甲酰甲基]-0,0-二甲基二硫代磷酸酯(安果),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,TheBritish Crop Protection Council,London,第625页);

[0163] (XXIII)4-甲硫基-3,5-二甲苯基氨基甲酸甲酯(灭虫威),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British CropProtection Council,London,第813页);

[0164] (XXIV)7-氯双环[3.2.0]庚-2,6-二烯-6-基-二甲基磷酸酯(蚜螨磷),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The BritishCrop Protection Council,London,第670页);

[0165] (XXV)1-(6-氯-3-吡啶基甲基)-N-硝基咪唑啉-2-基亚胺(吡虫啉),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年,The British CropProtection Council,London,第706页);

- [0166] (XXVI) 2- 异丙基苯基氨基甲酸甲酯 (异丙威), 出自 “The Pesticide Manual” 第 11 版 (1997 年, The British Crop Protection Council, London, 第 729 页) ;
- [0167] (XXVII) O, S- 二甲基硫代磷酸胺 (甲胺磷), 出自 “The Pesticide Manual” 第 11 版 (1997 年, The British Crop Protection Council, London, 第 808 页) ;
- [0168] (XXVIII) S- 甲基 -N-(甲基氨基甲酰氧基) 硫代乙酰胺 (乙胥威), 出自 “The Pesticide Manual” 第 11 版 (1997 年, The British Crop Protection Council, London, 第 815 页) ;
- [0169] (XXIX) 3-(二甲氧基膦氧基) 丁 -2- 烯酸甲酯 (速灭磷), 出自 “The Pesticide Manual” 第 11 版 (1997 年, The British Crop Protection Council, London, 第 844 页) ;
- [0170] (XXX) O, O- 二乙基 -O-4- 硝基苯基硫代磷酸 (对硫磷), 出自 “The Pesticide Manual” 第 11 版 (1997 年, The British Crop Protection Council, London, 第 926 页) ;
- [0171] (XXXI) O, O- 二甲基 -O-4- 硝基苯基硫代磷酸 (对硫磷 - 甲基), 出自 “The Pesticide Manual” 第 11 版 (1997 年, The British Crop Protection Council, London, 第 928 页) ;
- [0172] (XXXII) S-6- 氯 -2,3- 二氢 -2- 氧代 -1,3- 苯并噁唑 -3- 基甲基 -O, O- 二乙基二硫代磷酸酯 (伏杀硫磷), 出自 “The Pesticide Manual” 第 11 版 (1997 年, The British Crop Protection Council, London, 第 963 页) ;
- [0173] (XXXIII) 2- 二甲基氨基 -5,6- 二甲基嘧啶 -4- 基 - 二甲基氨基甲酸酯 (抗蚜威), 出自 “The Pesticide Manual” 第 11 版 (1997 年, The British Crop Protection Council, London, 第 985 页) ;
- [0174] (XXXIV) 2- 异丙氧基苯基氨基甲酸甲酯 (残杀威), 出自 “The Pesticide Manual” 第 11 版 (1997 年, The British Crop Protection Council, London, 第 1036 页) ;
- [0175] (XXXV) 1-(3,5- 二氯 -2,4- 二氟苯基) -3-(2,6- 二氟苯甲酰) 脲 (伏虫脲), 出自 “The Pesticide Manual” 第 11 版 (1997 年, The British Crop Protection Council, London, 第 1158 页) ;
- [0176] (XXXVI) S- 叔丁基硫代甲基 -O, O- 二甲基二硫代磷酸酯 (特丁磷), 出自 “The Pesticide Manual” 第 11 版 (1997 年, The British Crop Protection Council, London, 第 1165 页) ;
- [0177] (XXXVII) (3- 叔丁基 -1- 二甲基氨基甲酰基 -1H-1,2,4- 三唑 -5- 基硫代) - 乙酸乙酯 (唑蚜威), 出自 “The Pesticide Manual” 第 11 版 (1997 年, The British Crop Protection Council, London, 第 1224 页) ;
- [0178] (XXXVIII) 阿巴美丁, 出自 “The Pesticide Manual” 第 11 版 (1997 年, The British Crop Protection Council, London, 第 3 页) ;
- [0179] (XXXIX) 2- 仲丁基苯基氨基甲酸甲酯 (仲丁威), 出自 “The Pesticide Manual” 第 11 版 (1997 年, The British Crop Protection Council, London, 第 516 页) ;
- [0180] (XL) N- 叔丁基 -N' -(4- 乙基苯甲酰) -3,5- 二甲基苯甲酰肼 (虫酰肼), 出自 “The Pesticide Manual” 第 11 版 (1997 年, The British Crop Protection Council, London, 第 1147 页) ;
- [0181] (XLI) (. +.) -5- 氨基 -1-(2,6- 二氯 - . α . . . α . . . α . - 三氟对甲苯基) -4- 三氟

甲基亚磺酰基吡唑-3-甲腈(氟虫腈),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年, The British Crop Protection Council, London, 第545页);

[0182] (XLII) (RS)- α -氰基-4-氟-3-苯氧基苄基(1RS,3RS;1RS,3RS)-3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基环丙烷甲酸酯(β -氟氯氰菊酯),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年, The British Crop Protection Council, London, 第295页);

[0183] (XLIII) (4-乙氧基苯基)-[3-(4-氟-3-苯氧基苯基)丙基](二甲基)硅烷(氟硅菊酯),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年, The British Crop Protection Council, London, 第1105页);

[0184] (XLIV) (E)- α -(1,3-二甲基-5-苯氧基吡唑-4-基亚甲基氮氧基)对甲苯甲酸叔丁酯(啞螨酯),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年, The British Crop Protection Council, London, 第530页);

[0185] (XLV) 2-叔丁基-5-(4-叔丁基苄硫基)-4-氯哒嗪-3-(2H)-酮(啞螨酮),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年, The British Crop Protection Council, London, 第1161页);

[0186] (XLVI) 4-[[4-(1,1-二甲基苯基)苯基]乙氧基]啞唑啉(啞螨醚),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年, The British Crop Protection Council, London, 第507页);

[0187] (XLVII) 4-苯氧基苯基-(RS)-2-(吡啶氧基)丙醚(蚊蝇醚),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年, The British Crop Protection Council, London, 第1073页);

[0188] (XLVIII) 5-氯-N-{2-[4-(2-乙氧基乙基)-2,3-二甲基苯氧基]乙基}-6-乙基嘧啶-4-胺(啞螨醚),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年, The British Crop Protection Council, London, 第1070页);

[0189] (XLIX) (E)-N-(6-氯-3-吡啶基甲基)-N-乙基-N'-甲基-2-硝基亚乙烯基二胺(烯啶虫胺),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年, The British Crop Protection Council, London, 第880页);

[0190] (L) (E)-N. sup. 1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-N. sup. 2-氰基-N. sup. 1-甲基乙脒(NI-25,啞虫脒),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年, The British Crop Protection Council, London, 第9页);

[0191] (LI) 阿维菌素 B. sub. 1, 出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年, The British Crop Protection Council, London, 第3页);

[0192] (LII) 得自植物的昆虫活性提取物,尤其是(2R,6aS,12aS)-1,2,6,6a,12,12a-六氢-2-异丙烯基-8,9-二甲氧基苯并吡喃[3,4-b]呋喃并[2,3-h]吡喃-6-酮(鱼藤酮),出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年, The British Crop Protection Council, London, 第1097页);以及得自印楝的提取物,尤其是印楝子素,出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年, The British Crop Protection Council, London, 第59页);和

[0193] (LII) 包含昆虫活性线虫的制剂,优选嗜菌异小杆线虫和异小杆线虫,出自“The Pesticide Manual”第11版(1997年, The British Crop Protection Council, London,

第 671 页);斯氏线虫,出自“ThePesticide Manual”第 11 版(1997 年,The British Crop ProtectionCouncil,London,第 1115 页);和Steinemema scaptedsci,出自“ThePesticide Manual”第 11 版(1997 年,The British Crop ProtectionCouncil,London,第 1116 页);

[0194] (LIV) 得自枯草芽孢杆菌的制剂,出自“The Pesticide Manual”第 11 版(1997 年,The British Crop Protection Council,London,第 72 页);或除从 GC91 或 NCTC11821 中分离出的化合物以外,得自苏云金芽孢杆菌菌株的制剂;出自“The Pesticide Manual”第 11 版(1997 年,TheBritish Crop Protection Council,London,第 73 页);

[0195] (LV) 包含昆虫活性真菌的制剂,优选黄萎病菌,出自“ThePesticide Manual”第 11 版(1997 年,The British Crop ProtectionCouncil,London,第 1266 页);布氏白僵菌,出自“The PesticideManual”第 11 版(1997 年,The British Crop Protection Council,London,第 85 页);和球孢白僵菌,出自“The Pesticide Manual”第 11 版(1997 年,The British Crop Protection Council,London,第 83 页);

[0196] (LVI) 包含昆虫活性病毒的制剂,优选 Neodipridon Sertifer NPV,出自“The Pesticide Manual”第 11 版(1997 年,The British CropProtection Council,London,第 1342 页);甘蓝夜蛾 NPV,出自“ThePesticide Manual”第 11 版(1997 年,The British Crop ProtectionCouncil, London,第 759 页);以及苹果蠹蛾颗粒体病毒,出自“ThePesticide Manual”第 11 版(1997 年,The British Crop ProtectionCouncil,London,第 291 页);

[0197] (CLXXXI) 7- 氯 -2,3,4a,5- 四氢 -2-[甲氧基羰基 (4- 三氟甲氧基苯基) - 氨基甲酰] 吡啶 [1,2e] 噁唑啉 -4a- 羧酸盐 (DPX-MP062, 因得克),出自“The Pesticide Manual”第 11 版(1997 年,The British CropProtection Council,London,第 453 页);

[0198] (CLXXXII) N' - 叔丁基 -N' - (3,5- 二甲基苯甲酰) -3- 甲氧基 -2- 甲基苯甲酰肼 (RH-2485, 甲氧虫酰肼),出自“The Pesticide Manual”第 11 版(1997 年,The British Crop Protection Council,London,第 1094 页);以及

[0199] (CLXXXIII) (N' - [4- 甲氧基联苯 -3- 基] - 肼甲酸异丙酯 (D 2341), 出自 Brighton Crop Protection Conference(1996 年第 487-493 页);

[0200] (R2)“Book of Abstracts”(212th ACS National MeetingOrlando,Fla.,1996 年 8 月,第 25-29 页,AGRO-020,Publisher :American Chemical Society(Washington,D.C.), CONEN :63BFAF)。

[0201] 一般说来,根据本发明的驱肠虫组合物包含按重量计 0.1 至 99%,尤其是 0.1 至 95%的式 1 的活性成分及其混合物,按重量计 99.9 至 1%,尤其是 99.8 至 5%的固体或液体混合物,所述固体或液体混合物包括按重量计 0 至 25%,尤其是 0.1 至 25%的表面活性剂。

[0202] 在根据本发明的方法的另一个实施方案中,可随时间以不同和独立的方式来施用式 1 的化合物和上文所述附加的化合物。在此情况下,优选以一定的间隔时间来间隔施用,例如两次施用间隔一个月。

[0203] 下列测试证实了本发明的化合物对具体害虫的防治功效。然而,由所述化合物提供的害虫防治保护不限于这些物种。

[0204] 本发明的生物学实施例

[0205] 测试 A

[0206] 成年丝光绿蝇（丽蝇）：将成年飞蝇放置于血液琼脂床上（于单独测试井凹中；每个井凹4只飞蝇），其中在琼脂固化之前，将受试化合物（（3-溴-N-[4-氯-2-甲基-6-[(甲基氨基)羰基]苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-甲酰胺）溶解/悬浮。飞蝇可通过摄取和接触来吸收受试化合物。按2小时、4小时和24小时后的死飞蝇数来给测定评分。

[0207]

	测试中的 飞蝇数	2 小时后的 死亡飞蝇数		4 小时后的 死亡飞蝇数		24 小时后的 死亡飞蝇数	
比率 (ppm)		毒死蝇	受试 化合物	毒死蝇	受试 化合物	毒死蝇	受试 化合物
100	4	4	0	4	0	4	3
50	4	4	0	4	0	4	2
25	4	3	0	4	0	4	2

[0208]

10	4	1	0	4	0	4	1
1	4	0	0	1	0	4	0
未处理的	16	0	0	0	0	0	0

[0209] 丝光绿蝇（昆虫；丽蝇）幼虫。

[0210] 使受试化合物与干血清混合，并且放置到幼虫可摄取的滤纸盘上。通过进食和接触产生活性。每个数据点进行四次平行测定。

[0211] 结果：在1.0ppm下，受试化合物（3-溴-N-[4-氯-2-甲基-6-[(甲基氨基)羰基]苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-甲酰胺）在24小时后提供90-100%的死亡率。在0.5ppm下，氟虫腈在24小时后提供90-100%的死亡率。

[0212] 虽然已详细描述了本发明及其优点，但是应当理解，在不背离由所附权利要求限定的本发明的精神和范围的情况下，本文中可进行各种改变、替代和更改。