〔19〕中华人民共和国专利局

[11]公开号 CN 1037143A

〔12〕发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 89100451.3

[51] Int.Cl⁴
C07C103/75

〔43〕公开日 1989年11月15日

[22]申请日 89.1.26

[30]优先权

[32]88.1.26 [33]DE [31]3802175.7

[71]申请人 赫彻斯特股份公司

地址 联邦德国美因河

[72]发明人 曼弗雷德·克恩 沃纳·克瑙夫
卡尔·马特斯特克 伯克哈特·萨克斯
厄恩斯特·施米德特 欧内斯·舒克
安娜·沃尔特斯多夫
海因里希·威克

[74]专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利代理部

代理人 孙令华

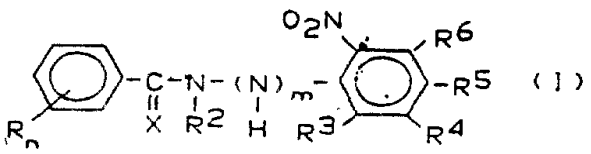
C07C149/415 C07C131/00
A01N 37/22

说明书页数: 34 附图页数:

[54]发明名称 N-苯基苯甲酰胺类和N-苯基苄胺肟类，其制备方法，含有这二类化合物的制剂及其用作杀虫剂的用途

[57]摘要

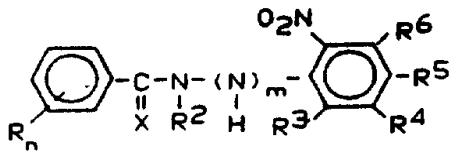
本发明涉及通式(I)的化合物，通式(I)中各符号的意义如说明书所述。本发明还涉及该化合物的制备方法。化合物(I)及其可用于农业的盐具有杀虫、杀螨、杀真菌和杀线虫的作用。



(I)

权　利　要　求　书

1.一种制备式(I) 化合物和由其生成的可用于农业的盐类的方法



(I),

式中

X 代表O，S或NOR^1，

R 代表氢，卤素，CN，SCN，NO_2，OH，氨基甲酰或C_1-C_4烷基，烷氧基或C_1-C_4硫代烷基（后三者可以完全或部分由卤素取代），或苯基，硫代苯基或苯氧基(这三者可以由1 或2 个卤素原子一个CF_3基取代)，或(C_{1-4}酰基

R^1 代表氢或可以完全或部分由卤素取代的C_1-C_4烷基、C_1-C_4烯基或C_1-C_4炔基，或C_1-C_4酰基，或氰代甲基，

R^2 代表氢，C_1-C_4烷基或S-CCl_3，

R^3 和R^5 各自代表NO_2，卤素，CN，COOH，$CONH_2$或可以完全或部分由卤素取代的C_1-C_4烷基或C_1-C_4烷氧基，或C_1-C_4烷氧基羰基，或$CONR^7R^8$，

R^4 代表氢或卤素，

R^6 代表氢，卤素，C_1-C_4烷氧基或苯氧基，

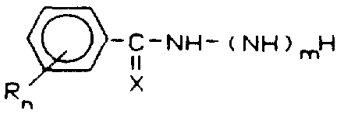
R^7 和R^8 代表C_1-C_4烷基，

m 代表0 或1 的

n 代表0 到5 ，

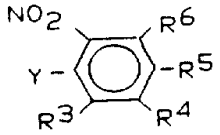
但是，当X为NOR^1 的情况时，m 必须等于0 ，该方法包括：

a)使分子式(Ⅱ) 化合物与一种或(Ⅲ) 的化合物在碱的存在下相反应



(II)，

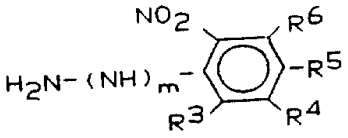
式中R，X，n 和m 所代表的与式 I中的意义一样，



(III)，

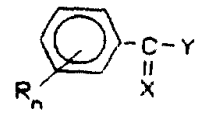
式Ⅲ中R^3，R^4，R^5，和R^6 所代表的与式 I中的意义一样而Y代表卤素，或

b)使一种式(Ⅳ) 化合物与一种式(Ⅴ) 化合物在一种碱存在时相反应，



(IV)，

式中m ，R^3，R^4，R^5，和R^6 所代表的与式 I中的意义一样



(V)，

式中R，n 和X所代表的与式 I中的意义一样而Y代表卤素。

2.权利要求1 的方法，其中通式I 中R为卤素或 CF_3 ，X代表氧或 NOR^1，R^1 代表(C_1- C_4)-烷基，R^2 代表H，R^3 代表 NO_2或 CF_3 ，R^4 代表H，R^5 代表 NO_2 ，CF_3 或CN，R^6代表氢或氯，m 为0，n为1或者2 。

3.一种含有有效量的式(I) 化合物的杀虫剂，杀真菌剂，杀螨剂或杀线虫剂。

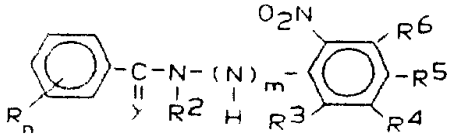
4.用式 I的一种化合物来控制螨虫类，有害昆虫，有害菌类或线虫类。

5.一种控制螨虫类，有害昆虫，有害菌类或线虫类的方法，它包括应用一种有效量的式 I化合物于这些害虫或由害虫所感染过的植物、地点或物质。

N- 苯基苯甲酰胺类和N- 苯基苄胺肟类、其制备方法、含有这二类化合物的制剂及其用作杀虫剂的用途

如所周知，某些取代的苯酰苯胺，如在医药化学杂志 Journal of Med. Chemistry 12，957（1969）中所述的，具有杀菌性能。现业已发现一类新的N- 苯基苯甲酰胺和N- 苯基苄胺肟都具有有效的杀虫，杀真菌，杀螨或杀线虫的作用

所以本发明涉及分子式 I所表示的化合物以及由其生成的可用于农业的盐类：



（I），

式中

X 代表O，S或NOR^1，

R 代表氢，卤素，CN，SCN，NO_2，OH，氨基甲酰或，C_{1-4}烷基，C_1-C_4烷氧基或C_1-C_4硫代烷基，后三者可以完全或部分由卤素取代，或苯基，硫代苯基或苯氧基，后三者可以由1 或2 个卤素原子或一个CF_3基取代，或C_1-C_4酰基，

R^1 代表氢或C_1-C_4烷基，C_1-C_4烯基或C_1-C_4炔基（这些可

以完全或部分由卤素取代）或 C_1-C_4 酰基，或氰代甲基，

R^2 代表氢，C_1-C_4 烷基或 S- CCl_3，

R^3 和 R^5 各自代表 NO_2，卤素，CN，COOH，$CONH_2$ 或 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 烷氧基（后二个可以完全或部分由卤素取代），或 C_1-C_4 烷氧基羰基或 $CONR^7R^8$，

R^4 代表氢或卤素，

R^6 代表氢，卤素，C_1-C_4 烷氧基或苯氧基，

R^7 和 R^8 代表 C_1-C_4 烷基，

m 代表0 或1，

n 代表0 到5，

但附有这样条件，当X为 NOR^1 的情况时，m 必须等于0 。

在此式中，烷基代表直链或支链烷基，而卤素最好是 F和 Cl 。

分子式（ I）所代表的化合物最好是式中 R代表卤素或 CF ，n 为 1 或2 ，X为氧或 NOR^1 ，R^1为（ C_1-C_4)-烷基，R^2 为H，R^3 为 $-NO_2$ 或 CF_3 ，R^4 为H，R^5 为 NO_2 、CF_3 或CN，R^6 为氢或氯而m 为0 的化合物，以及其可以用于农业的盐类。

以下是由分子式（ I）所代表的许多特别好的化合物：N-(2,6-二硝基-4- 三氟甲基苯基)-4-三氟甲基- 甲基苄胺肟，N-(3 氯代-2,6- 二硝基-4- 三氟甲基苯基)-4-三氟甲基- 甲基苄胺肟，N-(2,4-二硝基-6- 三氟甲基苯基)-4-三氟甲基- 甲基苄胺肟，N-(3 氯代-2,6- 二硝基-4- 三氟甲基苯基)-4-三氟甲基- 烯丙基苄胺肟，N-(3-氯代-2,6- 二硝苯基-4 - 三氟甲基苯基)-4-三氟甲基- 甲基苄胺肟，N-(3-氯代-4- 氰代-2,6,-二硝基苯基）-4- 三氟甲基甲基苄胺肟，N-(3-氯代-2,6,-二硝基-4- 三氟甲基苯基)-3-三氟甲基- 甲基苄胺肟，N-(2,4-二硝基-6- 三氟甲基苯)-3-三氟甲基- 甲基苄胺肟，N-(3 氯代-2,6- 二硝基-4- 三氟甲基苯

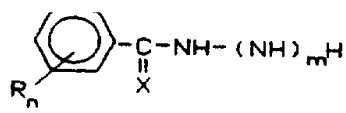
基)-4-氯代- 甲基苄胺肟，N-(3 氯代-2,6- 二硝基-4- 三氟甲基苯基)-4-甲基- 甲基苄胺肟，N-(2,6- 二硝基-4- 三氟甲基苯基)-4-三氟甲基- 苯甲酰胺，N-(3-氯代-2,6- 二硝基-4- 三氟甲基苯基)-4-三氟甲基苯甲酰胺，N-(3-氯代-2,6- 二硝基-4- 三氟甲基苯基)-4-氯代苯甲酰胺，N-(3-氯代-2,6- 二硝基-4- 三氟甲基苯基)-3-氯代苯甲酰胺，N-(2,6- 二硝基-4- 三氟甲基苯基)-4-氯代苯甲酰胺，N-(2,6- 二硝基-4- 三氟甲基苯基)-3-氯代苯甲酰胺，N-(2,6- 二硝基-4- 三氟甲基苯基)-3,4-二氯代苯甲酰胺，N-(3-氯代-2,6- 二硝基-4- 三氟甲基苯基)-3,4-二氯代苯甲酰胺，N-(2,6- 二硝基-4- 三氟甲基苯基)-3-三氟甲基苯甲酰胺，N-(3-氯代-2,6- 二硝基-4- 三氟甲基苯基)-3-三氟甲基苯甲酰胺，N-(2,6- 二硝基-4- 三氟甲基苯基)-2-氯代-4- 三氟甲基苯甲酰胺，N-(3-氯代-2,6- 二硝基-4- 三氟甲基苯基)-2-氯代-4- 三氟甲基苯甲酰胺，以及由上述化合物所生成的可用于农业的盐类。

本发明也包括式(I) 所代表的化合物的盐类，它们是将 R^2 基由合适的金属或铵取代而成的。如为酰胺类化合物(m = 1)，则盐是通过在紧靠着含- NO_2 取代基的苯核的酸性氮原子上进行去质子化作用而生成的。

式(I) 所代表的化合物的合适盐类是能用于农业的盐类，特别是碱金属盐、碱土金属盐、铵盐或由有机基(如烷基或羟烷基) 取代一个到四个氢的铵盐。

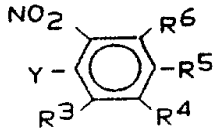
本发明还涉及一种制造式(I) 所代表的化合物的方法，该方法包括

a)使下面的分子式(Ⅱ) 所代表的一种化合物与分子式(Ⅲ) 所代表的一种化合物在碱存在时进行反应



(II) ,

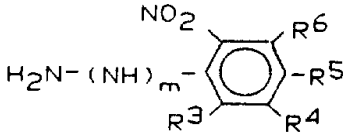
式中R，X，n 和m 的意义与式(I) 的相同，



(III)，

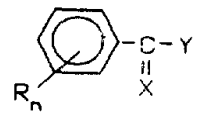
式中R^3，R^4，R^5，和R^6 的意义与式(I) 的相同，而Y代表卤素，或

b)使下面的分子式(Ⅳ) 所代表的一种化合物与分子式(V) 所代表的一种化合物进行反应，



(IV)，

式中m ，R^3，R^4，R^5，和R^6 的意义与式(I) 的相同，



(V)，

式中R，n 和X的意义与式（ Ⅰ）的相同而Y代表卤素。

用作反应原料的化合物（ Ⅱ）的制备方法如 Chem. Rev. 62卷（ 1962）155 - 安183 页所述。

式（ Ⅲ）的化合物在市场上有大量出售，或者易于按照文献上登载过的方法制得。

式（ Ⅳ）的化合物是由式（ Ⅲ）的化合物与氨或肼反应制得。

式（ Ⅴ）的化合物的制法见 chem. Ber. 18（ 1985）1189页。

式（ Ⅰ）化合物的盐类可用本专业人员所熟知的方法制得，例如，与碱金属氢氧化物或碱土金属氢氧化物相反应而制得。在进行制备式（ Ⅰ）化合物的反应时有过量的碱存在时会直接生成相应的盐。

在制造该类化合物时最好要有一种碱和一种或数种溶剂或稀释剂存在。适用的惰性溶剂为脂肪族或芳族烃，如苯、甲苯、二甲苯和石油醚；卤代烃类，如氯苯、二氯甲烷、氯化乙烯、氯仿，四氯化碳或四氯乙烯；醚类，如二烷基醚，苯甲醚或四氢呋喃；腈类，如乙腈或丙腈；N，N'-二烷基酰胺类，如二甲基甲酰胺，二甲基亚砜；和酮类，例如丙酮或丁酮。

适用的碱类是本专业人员所熟悉的化合物，如碱金属或碱土金属的碳酸盐，如碳酸钾或碳酸钙，或碱金属或碱土金属的氢氧化物如氢氧化钾、氢氧化钠或氢氧化钙，或氢化钠，丁基锂或叔丁酸钾。

反应温度取决于所选用的反应条件、溶剂或稀释剂和碱。一般，反应温度是在-30 ℃至130 ℃的范围内，最好在-20 ℃至80℃之间。

化合物（ Ⅱ）和（ Ⅲ）或（ Ⅳ）和（ Ⅴ）的用量大约是化学计算量，任一种成分的用量都可超出化学计算量10% 。

酸- 结合剂的用量至少是化学计算量，但在大多数情况是过量的。采用通常的方法处理，在采用与水不相溶混的溶剂时，通过与水振荡来萃取，。在采用与水能溶混的溶剂时，处理时先加水稀释，再用一种与水不能溶

混的溶剂来萃取产品。

所制得的式(I) 化合物成结晶状或为蒸馏不出的油状物。我们可以在合适的溶剂中结晶以进行精制，或是将产品用色谱法在硅胶上进行精制。

本发明的式[I] 化合物的特点是具有显著的杀真菌作用。它对已侵入植物组织的其菌病原体也能成功地加以控制，这对于受到传染已产生真菌病害而用通常的杀真菌剂已不能有效地控制的情况是特别重要而有益的。本发明所述化合物的杀菌谱包含能杀灭大量各种在经济上很重要的植物病原体真菌，例如，梨孢霉属 oryzae ，黑星菌属 inaequalis，甜菜寄生病原属，新月菌属菌种，单轴霉属葡萄生菌，假霜霉属古巴菌，各种患锈病菌和假小尾孢霉属团毛状菌(pseudocercosporella herpotrichoides) 。对苯并咪唑类和二碳草酰亚胺类敏感和抗耐的葡萄孢属灰色(cinerea) 菌株也能杀灭得特别好。

此外，本发明的化合物还适用于工业领域，例如，用作木材防腐剂，作为涂料防腐剂，用于金属加工用冷却润滑剂的防腐剂或用作钻孔油和切削油的防腐剂。

本发明的活性化合物可以通常的制剂形式，单独使用或是与其它在文献上已公开的杀菌剂结合使用。

可按照本发明与式 I化合物结合使用的文献上已知的杀菌剂的例子有：imazalil，prochloroz，fenapanil ， S S F105 ，triflumizol ， P P 969 ，flutriafol， Bay- M E B6401， Propicorazol ，etacomazol，diclobutrozol ，bitertanol，三唑二甲酮，traaimenol，氟二唑，克啉菌，吗菌灵，fenpropimorph ，falimorph ， S- 32165，chlobengthiazone ，苯吡醇，buthiobat ，fenpropidin ，噻氨灵，双氯苯嘧醇，nuarimol，嘧菌醇，乙菌啶，甲菌啶，磺酸丁嘧啶，rabenzazale ，三唑苯噻，lucbenzimine ，pyroxyfur ， N K- 483 ， P P- 389 ，pyorquilon，

甲羟异恶唑，fenifriopan ，UHF- 8227，cymoxanil ，dichlorunanid ，敌菌丹，克菌丹，灭菌丹，对甲抑菌灵，百菌清，氯唑灵，iprodione（分子式Ⅱ），procymidon，rinslozolin ，metomelan ，myclozolin，dichlozolindte，fluorimide，敌菌酮，灭螨猛，nitrothalisopropyl，二噻农，敌螨普，乐杀螨，薯瘟锡，毒菌锡，萎锈灵，氧化萎锈灵，比锈灵，merhfuroxam ，一甲呋萎灵，fuzmecyalox ，麦锈灵，灭锈灵，灭锈胺，mepronil，flutalanil，麦穗宁，涕必灵，多菌灵，苯菌灵，托布津，甲基托布津，CGD- 94240 F，IKF- 1216，代森锰锌（mancozeh）代森锰，代森锌，代森钠，福镁双，probineb，丙威硫，propamocarb ，多果定，双胍盐，氯硝胺，五氯硝基苯，地茂散，四氯硝基苯，联苯，敌菌灵，8-羟基喹啉铜，氧化铜，硫，fosetylaluminem ，十二烷苯磺酸钠，十二烷硫酸钠，C13/ C15- 醇- 醚磺酸酯，sodium cetosfearyl phosphafe seter ，二辛基硫贷丁二酸钠，异丙萘磺酸钠，义甲基二萘基磺酸钠，鲸锆醇基三甲基氯化铵，长链的伯，仲，叔胺类盐，烷基丙烯胺，月桂醇基溴化吡啶，乙氧基季铵化脂肪胺（ethoxylated quaternized fatty amines ），氯化烷基二甲基苯基铵，1-羟乙基-2- 烷基咪唑啉。

上述组合物组分都是已知的活性化合物，它们大部分都登载在CH. R. Worthing ，U. S. B. Walker ，杀虫剂手册，第7 版（1983），British crop proteetion council 。

这些活性化合物能为植物很好接受，并对热血动物具有良好的毒性，同时也适用于控制动物的害虫，尤其是有害昆虫、蜘蛛、蠕虫和软体动物。特别适用于控制农业、畜牧业、林业、库存品和材料防护方面和卫生方面的害虫和蜘蛛。它们对一般敏感和能抗耐的害虫都是有效的，也对其整个生长期或个别阶段是有效的。上述害虫包括以下列：

蜱螨目，例如粗脚粉螨，Agras spp.，Ornithrodoros spp.，鸡

皮刺螨，Eriophyes ribis ，柑桔锈螨，牛蜱，扇头蜱，花蜱，璃眼蜱，硬蜱，瘿螨，痒螨，疥螨， 线螨，苜蓿苔螨，全爪螨，叶螨，始叶螨，小爪螨和真叶螨等翅目，例如Onisaug asselus ，Armadium yulgare 和Poraellio caber ；B砺侥；例如，Blaniulus guttulatus。蜈蚣目，例如地蜈蚣；蛐蜒目，如Scutigerella immaeulata 。缨尾目，例如，西洋衣鱼。弹尾目，例如，有刺跳虫；直翅目，例如，东方 蠊，镁洲大蠊，Leucophea maderge ，德国小蠊，家蟋蟀，蝼蛄，热带飞蝗，殊种蚱蜢，和沙漠蝗；革翅目，例如欧洲球蝮；虱目，例如Phylloera vasfatrix ，瘿绵蚜，体虱，血虱，颚虱；食毛目，例如Trichocheetas spp 和Damalinee spp.；缨翅目，例如温室条蓟马和棉蓟马；异翅亚目，例如扁盾 ，Dysderaus infermedius ，甜菜拟网 ，Cimex laatularius ，Rhodnius prolixus 和Trifoma spp.；同翅目，例如，甘蓝粉虱，甘薯粉虱，温室粉虱，棉蚜，Braricornyne brassicae，茶鹿隐瘤蚜，Doralis fabae ，Doralis pomi，苹果绵蚜，桃大尾蚜，Macrosiphium ，avenae，瘤蚜，忽布 额蚜，禾谷缢管蚜，微叶蝉，Eusaelus bilobafus，Naphoterrex cinctiaeps，褐盔蜡蚧，Saissefia oleae ，灰稻虱，稻褐飞虱，红圆蚧，Apidiofus hederae ，粉蚧和木虱；鳞翅目，例如，棉红铃虫，松天蛾，冬尺蛾，Lithocolletis blancardella，苹果巢蛾，Plutella maculipennis ，天幕毛虫，黄毒蛾，毒蛾，棉潜蛾，桔叶潜蛾，地老虎，切根虫，地虎，棉斑实蛾，叶蛾，甜菜夜蛾，甘蓝夜蛾，小眼夜蛾，斜纹夜蛾，粘虫，粉纹夜蛾，苹囊蛾粉蝶，螟，蜡螟，Cocoecio podana ，Capua reticulana，枞色卷蛾，葡萄果囊蛾，茶长卷蛾和棘绿卷蛾；鞘翅目，例如具斑窃囊，谷囊，Bruchidius obtectus ，大豆象，Hylotrupes bajulua，赤杨紫跳甲，马铃薯甲虫，辣根猿叶虫，叶甲，油菜蓝跳甲，墨西哥豆甲，隐食甲，锯谷

盗，Amthomumus spp.， Sitophilus spp.,葡萄黑耳喙象，香蕉根象甲，甘蓝荚象甲，苜蓿叶象甲，皮囊，Trogoderma ，Anthrenus spp.，毛囊，粉囊，油菜花露尾甲，蛛甲，Niptus hololeucus ，麦蛛甲 ,拟谷盗，黄粉虫，叩甲，金针虫，Melolontha melolontha ，六月金龟，和Costelyfra zaalandico ；膜翅目，例如，松叶蜂，叶蜂，蚁，法老蚁和胡蜂；双翅目，例如，Aedes spp.，Anophelesspp.， Culex spp.，黄猩猩果蝇，蝇，Fannia spp.， Calliophora eryrhrocephala，绿蝇，果蝇，Cuterebra spp.， Gastrophilus spp.， Hypobosca spp.，Stomoxys spp.， Oesfrus spp.，皮蝇，虱，Tannia spp.， Bibiohortaslanus ，瑞典麦杆蝇，花蝇，菠菜潜叶花蝇，地中海实蝇，油榄实蝇和Tripula paludosa；蚤目，例如鼠蚤和毛列蚤；蜘蛛目，例如蝎和盗蛛；蠕虫，例如血矛线虫，毛园线虫，骨线，右柏线虫，chabertia ，strongyloids，结节线虫，Hyostrongulus，Ancylostoma，蛔虫（ Ascaris），异刺线虫（ Heterakis）以及片吸虫；还有些毒害植物的线虫，例如那些Melaidogyne，Heterodera ，Ditylenchus，Aphelenchoides Radopholus ，Globodera，Pratylenchus ，Longidorous，和Xiphinema；腹足软体动物，例如灰蛞蝓，阿勇蛞蝓，Lymnaea spp.，Galba spp.，琥珀螺，Siophalariaspp.， Bulinus spp.，和Oncomelania spp.。

本发明也涉及含有式（ I）化合物与合适辅助料的制剂。

总之，本发明的制剂含有1 至95% 重量的式（ I）活性化合物。

它们可以根据生物参数和/ 或物理- 化学参数预测结果配成各种不同制剂。以下是一些适用的可能制剂：可湿性粉（ WP），可乳化浓缩剂（ EC），水溶液（ SC），乳液，喷洒液和油基或水基分散液，悬浮/ 乳化液（ SC），雾剂（ DP），拌种剂，和各种颗粒剂如微粒、喷洒颗粒、

吸收和吸附粒、水分散粒（WG），ULV剂，微胶囊，饵料。

这些各不相同的制剂基本上是已知的，例如，在Winnacker kuchler著“化学工艺学”（德文）第七卷，C. Hauser 出版，Munich，第4版，1986；Van Falkenberg 著“杀虫剂配方”，Mercel Dekker N. Y. 第2 版，1972- 73；和K. Martens，“Spray Drying Handbook”第3 板，1979，G. Goodwin Ltd，London 等文献上均有描述。

所需要的制剂辅料，如惰性材料、表面活性剂、溶剂和其它添加剂也是已知的，例如，在Watkins“杀虫剂粉稀释剂及载体手册”第2 版，Darland Books，Caldwell N. J.；H. Y. Olphen，“粘土胶体化学引论”第2 版，J. Wiley & sons N. Y.；Marschen“溶剂指南”第2 版，Interscience，N. Y. 1950；Mccurcheon“洗涤剂和乳化剂年鉴”，MC Publishing Corporation，Ridgewood N. J.；Sisley and Wood“表面活性剂大全”，Chemicalpublishing co. Inc.，N. Y. 1964；Schonfeldt“Grenzflachenaktir Äthylenoxidaddukte”，Wiss，Verlags gesell Stuttgart 1976；Winnack- Küchler，“化学工艺学”第7 卷，C. Hauser Verlag，Munich，第4 版，1986，等文献上均有描述。

这些制剂，也可与其他有效杀虫剂、肥料和/ 或生长调节剂相组合，例如配制成最终组合物。可湿润性粉是一种在水中均匀分散的制剂，它除了含有活性化合物外，还含有一种稀释剂或惰性物和湿润剂（如聚氧化乙烯烷基酚醚，聚氧化乙烯脂肪醇醚，烷基磺酸盐或烷基苯磺酸盐）以及分散剂（例如木质素磺酸钠，2,2′- 二萘甲烷-6,6′-二磺酸钠，二丁基萘磺酸钠或油酰甲基牛磺酸钠）。可乳化浓缩液是将活性化合物溶解在有机剂如丁醇、环已酮、二甲基甲酰胺、二甲苯或高沸点芳香溶剂或烃中，

并加一种或多种乳化剂制成。可应用的乳化剂的例子有：烷基芳基磺酸钙如十二烷基苯磺酸钙，或非离子型乳化剂如脂肪酸聚乙二醇酯，烷基芳基聚乙二醇醚，氧化丙烯/ 乙烯缩合物，烷基聚醚，山梨糖醇酐脂肪酸酯，聚氧化乙烯山梨糖醇酐脂肪酸酯或聚氧化乙烯山梨糖醇的酯类。

雾剂是由活性化合物与固体细粉，例如滑石粉，天然粘土，如高岭土、膨润土、叶蜡石或硅藻土、混和均匀制得。制备颗粒剂的方法既可以是将活性化合物液喷雾在吸附性粒状惰性材料上或可以将活性化合物浓缩物借助于粘合剂（如聚乙烯醇，聚丙烯酸钠或矿物油）粘附在载体表面。所用载体为砂、高岭土或颗粒惰性料。

活性化合物在可湿润粉中的浓度，例如，约为10至90%（重量）。活性化合物在可乳化浓缩物中的浓度可以约为5 至80%（重量）。在配制成雾剂形式时，在大多数情况下活性化合物占5 至20%（重量）；喷洒液中活性化合物的含量约为2 至20%（重量）。在颗粒剂中活性化合物的含量部分取决于所用活性化合物是液体还是固体，部分取决于所用配制颗粒的辅料，填料等。

此外，上述活性化合物组合物适当时还可以含增粘剂、湿润剂、分散剂、乳化剂、渗透剂、溶剂、填料或载体，这些通常在特定情况下使用。

使用量视外界情况而变化，如温度、湿度等。它可以在很大范围内变化，例如每公顷用0.005 到10.0公斤或更多的活性物质，但是最好用量在0.01到5 公斤/ 公顷。

本发明的活性化合物可以成为商业配制品和由这些配制品制成应用品形式供售，后者如与其它活性化合物，如杀虫剂、引诱剂、消毒剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、助长剂或除莠剂等混合使用。

杀虫剂包括例如，磷酸酯类，氨基甲酸化合物，羧酯类，甲脒类，锡化合物，由微生物制备的物质等。下面是混合物的较可取的组分：

1. 磷化合物族：乙酰甲胺磷，azamethipnos，乙基谷硫磷，谷硫磷，溴硫磷，乙基溴硫磷，毒虫畏，氯甲硫磷，氯蜱硫磷，甲基氯蜱硫磷，一O五九，甲基异一O五九，磺吸硫磷，dialifos，二嗪农，敌敌畏，百治磷，O，O-1,2,2,2 tetra chlorerthylphosphothioafe（SD208 304），乐果，乙拌磷，苯硫膦，乙硫磷，丙线磷，乙嘧硫磷，伐灭硫磷，克线磷，杀螟松，砜线磷，倍硫磷，地虫硫膦，安果，hopfenophos，sozophos，甲丙乙拌磷，异恶唑硫磷，马拉硫磷，丁烯硫磷，甲胺磷，甲噻硫磷，水杨硫磷，速灭磷，久效磷，二溴磷，氧化乐果，砜吸硫磷，一六O五，甲基一六O五，稻丰散，三九一一，伏杀硫磷，氧环胺磷，亚胺硫磷，磷胺，腈肟磷，嘧啶硫磷，甲基嘧啶硫磷，profenofos，丙虫磷，巴胺磷，低毒硫磷，pyraclofos，苯哒嗪硫磷，喹恶硫磷，sulprofos，双硫磷，特丁三九一一，杀虫畏，甲基乙拌磷，三唑硫磷，敌百虫，完灭硫磷；

2. 氨基甲酸酯族：丁醛肟威，丁苯威，（2-仲丁苯基甲基氨基甲酸酯）（BPMC），西维因，呋喃丹，carbosulfan，cloethocarb，benfuracarb，乙硫甲威，furathiocarba，异丙威，乙肟威，5-mathyl-m-cumenylbutyrylmerhglcarbamate，草肟威，灭定威，残杀威，thiodicarb，己酮肟威，sthyl 4,6,9-triaza-4-benzyl-6,10 dimorhyl-8-oxa-7-oxo-5，11-dithia-9-dodecanoate（OK135），1-meshyl & thio（ethylideneamino）n -methyl-N（morphorlinothio）-carbamate（UC51717），

3.羧酯类族，丙烯菊酯，alphamefrin，5- benzyl-3-furylmethyl（E）-（1R）-cis-2,2-dimethyl-3-(2-oxothiolan-3-ylidenemethyl) cyclopropanecarboxylate，右旋反丙烯菊酯，bioallethrin(1S)-cyc[illegible]ntylisomer)，苄呋菊酯，biphenate，（RS）-1-cyano-1-(6-ph

enoxy-2-pyridyl) methyl (1 R S)-trans-3-(4-fert butylphenyl) -2,2-dimethylcyclopropane-carboxylafe (NC I85193) , cycloprothrin , cyfluthrin , 腈二氯苯醚菊酯, cyphenothrin , deltametherin , esfenvalerate , fenfluthrin , fenpro-pathrin , 腈氯苯基醚菊酯, flucythrinnte , flumethrin, fluralinate(D-isomer), 二氯苯醚菊酯, pbeothrin(CR) -isomer), d-proalethrin, 除虫菊酯, (天然产品) , 苄呋菊酯, tefluthrin, 四甲菊酯以及tralomethrin;

4. 脒化合物族: 胺三氮螨, 杀虫脒基;

5. 锡化合物族: 三环锡, 螨完锡;

6. 其它:

abamectin , 苏云金杆菌, bensultap , 乐杀螨, 溴螨酯, buprofezin, 毒杀芬, 巴丹, 已知杀螨醇, chlorfluazuron, 2-(4-(chloropheny l)-4,5-diphenyl-thiophene UBI- T930) , chlorfentezine ,2-naphth-ylmethyl cyclopropane carboxylote(RO12- 0470) , cyromazin , ethyl N-(3,5-dichloro-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1- propoxyl)-phenyl)-corbomoyl)-2-chlorberrzo carboximiddfe, DDT, 三氯杀螨醇, N(N-(3,5-dichloro-4-(1,1,2,2-fetrafluor-ethoxy)-phenylamino) carbonyl-2,6-difluoro-benzamide(XRD473) , 伏虫脲, N-(2,3-dihydro-3-methyl-1,3-thiazol-2-ylidene)-2,4-xylidine, 消螨通, 消螨普, 硫丹, ethofenprox, (4-ethoxyphenyl)-dimethyl)-(3-3-phenoxyhenyl)-propyl)-silane, (4-ethoxy-phenyl)-(3-(4-fluoro-3-phenoxyphenyl)-propyl)-dimethyl-silane, fenoxycarb, 2-fluoro-5-(4-(4-ethoxyphenyl-4-(4-methyl-1-pentyl)-diphenylether(MT I800) , granulose and nuelear polyhedrol riruses , fanthicarb , flubenzimine, flucycloxuron, flufenoxuron , gamma-HCH, hexy-thi

azox，hydramethylnon（A C217300），irermectin，2-nitromethyl-4-5-dihydro-6 H-thiazine（SD52628）2-nitromethyl-3,4- dihydrothiazol（SD35651），2-nitromerthylene-1,2-thiazinon-3 yl-corbamol-dehyde（M L108477），克螨特，teflubenzuron 。tetradifon，tatrasul，thiocyclam，triflumuron 。

活性化合物在由商业出售制品制成的应用形式产品中的含量可以从0.00000001到100 %（重量），而最好是在0.00001 到1 %（重量）范围内。

本发明的活性化合物也适用于兽药领域和牧畜养殖方面防治内寄生冲和外寄生虫。

在此领域，本发明的活性化合物按熟悉的方式应用，如制成片剂、胶囊、药水或药粒口服，又如用浸渍、喷洒、浇淋，点涂和洒粉形式外用；还可以用注射形式使其不经肠道而进入体内。

因而，本发明所述的式（ I）新化合物也特别适用于禽畜生产（例如牛，羊，猪和家禽（如鸡，鹅等））。最好是将本发明的这些新化合物给动物口服，适当的话可放在合适的配制品（见前述）中，和与饮水或饲料放在一起。适合于特定情况的用药量和剂型，取决于家畜的种类和生长阶段，还取决于受害的严重程度。这是易于用通常的方法确定的。例如，对牛来说，新化合物的用药量可以按每公斤体重用0.01至1 毫克计算。

下列各实例可供阐明本发明。

A．配制实例

a)一种雾剂是由10重量份活性化合物与90重量份作为惰性填料的滑石粉混合，在打磨中将混合物磨成细末而制成。

b)一种易于在水中分散的可湿润性粉是由25重量份活性化合物、65重

量份含高岭土石英、10重量份木质素磺酸钠和1 重量份油酰甲基牛磺酸钠作为湿润剂和分散剂，在针板磨中研磨而制成。

c)一种易于在水中分散的分散浓缩物是由40重量份的活性化合物与7重量份硫代丁二酸半酯、2 重量份木质素磺酸钠和51重量份的水混合而成，在球磨机中将混合物研磨到细度小于5 微米。

d)一种可乳化浓缩液可以由15重量份的活性化合物、75重量份的环己酮为溶剂与10重量份乙氧化的壬基苯酚（ 10 E O）作为乳化剂制成。

e)颗粒剂可以用2 到15重量份的活性化合物和一种惰性粒状载体，如美国白土（ attapulgite ），浮石粒和/ 或石英砂制成。最好用实例b)中可湿润性粉的固体含量为30% 的悬浮体，将它喷到美国白土粒表面，然后干燥和均匀混和。这样做法，制成的颗粒的各成分的重量比例为可湿润性粉约占5 % 而惰性载体约为95% 。

B．化学实例

例1

N-(2,4-二硝基-6- 三氟甲基苯基)-2-乙酰氧基苯甲酰胺

将6.7 克2-氯代-3,5- 二硝基- 三氟甲基苯在50毫升四氢呋喃中的溶液在0 —5 ℃搅拌下滴加到4.5 克2-乙酰氧基苯甲酰胺在150 毫升四氢呋喃中的溶液中。在滴加时将4 克浓度为88% 的氢氧化钾细粉分成小批加到反应混合液中。反应混合物在0 ℃下搅拌2 小时，再在室温下搅拌12小时，然后倒到2 升水中，用浓盐酸酸化到 pH= 2 。经1 小时后将沉淀过滤并用水洗涤。所得反应物为无色晶体，收率是理论量 ，熔点157 ℃。

在表1 至表5 中通式（ I）的各种化合物都可用此方法制成。

例2

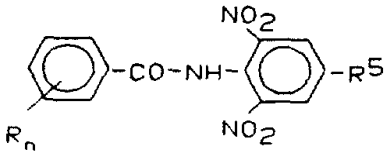
N-(3-氯代-2,6- 二硝基-4- 三氟甲基苯基)-4-三氟甲基- 甲基苄胺肟

将10.9克（50毫克分子）4-三氟甲基- 甲基苄胺肟和15.3克（50毫克分子）2,4-氯代-3,5- 二硝基- 三氟甲基苯的混合物在150 毫升四氢呋喃中的溶液，在0 ℃时边搅拌边滴加到一个3.3 克（110 毫克分子）浓度为80% 的氢化钠在250 毫升四氢呋喃1 的悬浮液中，反应混合物在20℃下保持6 小时。加8 毫升乙醇，将反应液倾到300 毫升0.5 N稀盐酸和300 毫升二氯甲烷的混合液中，将二层液相分离，水液再用100 毫升二氯甲烷萃取二次，合并的有机溶液在硫酸钠上干燥后，在20毫米减压下于40℃浓缩。

浓缩物在硅胶柱进行色谱提纯，用1 ：1 比的二氯甲烷：石油醚为洗提剂，所得上述化合物为16.1克（理论量的66%），呈黄色结晶。熔点为118 ℃。

表6 中通式（ I）的各种化合物都可以用此方法制备。

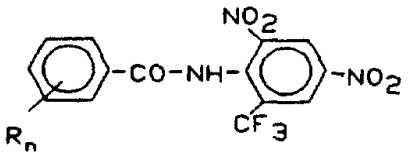
表1



(I)

实例编号	R_n	R^5	Mp
3	4-CF_3	CF_3	177°
4	2,6-F_2	CF_3	202°
5	4-Cl	CF_3	116°
6	2-F	CF_3	150°
7	2,6-Cl_2	CF_3	275°
8	2,4-Cl_2	CF_3	217°
9	4-CF_3O	CF_3	129°
10	4-J	CF_3	164°
11	4-CF_3,2-Cl	CF_3	227°
12	4-CF_3	CCl_3	90°
13	4-Cl	CCl_3	94°
14	2-CF_3,5-Cl	CF_3	
15	4-CN	CF_3	
16	3-SCN	CF_3	
17	2-Cl-4-F	CF_3	
18	4-F	CF_3	214°
19	2,4-F_2	CF_3	n_D^{19} : 1.5219
20	4-CF_2Cl	CF_3	145°
21	4-t-But	CF_3	157°
22	3,4-$(OC_2H_5)_2$	CF_3	177°
23	4-Br	CF_3	163°

表 2



(I)

续表1.

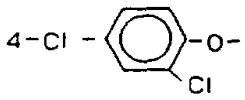
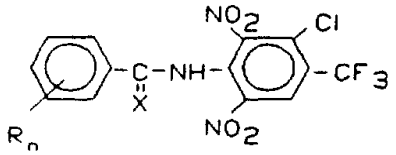
	R_n	MP
24	4-CF_3	149°
25	2,6-F_2	165°
26	4-Cl	142°
27	2,4-Cl_2	158°
28	3,4-Cl_2	187°
29	3-Cl	169°
30	2-CH_3COO	157°
31	3-CF_3	192°
32	4-Cl_3CO	n_D^{50} : 1,5800
33	2-Cl,4-CF_3	199°
34	3-SCN	
35	4-CN	
36		191°
37	2-Cl,4-F	n_D^{20} : 1,5458
38	4-t-But	160°
39	4-Br	138°
40	3,4-$(OC_2H_5)_2$	171°
41	4-F	192°
42	4-CF_2Cl	110°

表 3



(I)

实例	R_n	X	MP
43	4-CF_3	O	199°
44	4-Cl	O	211°
45	2-Br	O	246°
46	2-Cl,6-F	O	222°

续表3

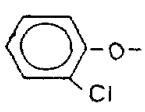
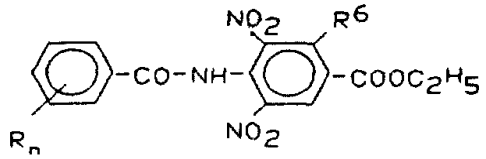
实例	R_n	X	P
47	2-Cl	O	230°
48	2,6-Cl_2	O	230°
49	2-NO_2	O	237°
50	2,4-Cl_2	O	237°
51	2,6-F_2	O	192°
52	2-F	O	178°
53	4-CF_3O	O	204°
54	2-CH_3COO	O	196°
55	4-J	O	220°
56	2,3,4,5,6-F_5	O	183°
57	3,4-Cl_2	O	205°
58	3-Cl	O	197°
59	3-CF_3	O	208°
60	4-Cl_3C-CO	O	197°
61	4-Cl	S	82°
62	2-OH	O	170°
63	2-Cl,4-CF_3	O	269°
64	4-CH_3COO	O	160°
65	2-Cl	S	205°
66	2-$CONH_2$ 3,4,5,6-Cl_4	O	300°
67	4-F	O	192°
68	2,3-Cl_2	O	
69	4-CN	O	243°
70	3-SCN	O	
71	4-Cl--O-	O	183°
72	2-Cl,4-F	O	n_D^{20} : 1,5398
73	2,4-F_2	O	n_D^{19} : 1.5313
74	4-CF_2Cl	O	196°
75	4-t-But	O	146°
76	3,4-$(OC_2H_5)_2$	O	185°
77	4-Br	O	234°

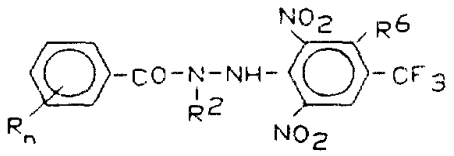
表4



(I)

实例	R_n	R^6	Mp
78	4-CF_3	Cl	170°
79	2,6-F_2	Cl	210°
80	4-Cl	Cl	Wachs
81	2,4-Cl_2	Cl	203°
82	3-Cl	Cl	120°
83	2-CH_3-COO-	Cl	152°
84	3-CF_3	Cl	45°
85	4-Cl_3CO-	Cl	60°
86	2-Cl,4-CF_3	Cl	282°
87	4-CF_3	H	161°
88	2,6-F_2	H	187°
89	4-Cl	H	101°
90	2-Cl,4-F	H	

表 5



(I)

实例	R_n	R^2	R^6	Mp
91	4-CF_3	H	Cl	217°
92	4-CF_3	CH_3	Cl	56°
93	4-CF_3	CH_3	H	Wachs
94	4-CF_3	H	H	225°

表 6

Verbindung gemäß Formel (I)

X = NOR^1, m = O

実例	R_n	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	Mp.
95	4-Cl	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	134°
96	4-Cl	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	132°
97	4-Cl	Me	H	CF_3	H	NO_2	H	90°
98	4-Cl	Me	H	CF_3	Cl	NO_2	H	
99	3-Cl	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	124°
100	3-Cl	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	120°
101	2-Cl	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	
102	4-Cl	$-CH_2-CH=CH_2$	H	NO_2	H	CF_3	H	102°
103	4-Cl	$-CH_2-CH=CH_2$	H	NO_2	H	CF_3	Cl	67°
104	4-Cl	$-CH_2-CH=CH_2$	H	CF_3	H	NO_2	H	
105	2,4-Cl_2	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	82°
106	2,4-Cl_2	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	112°
107	3,4-Cl_2	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	70°
108	3,4-Cl_2	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	103°
109	4-F	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	95°
110	4-F	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	121°
111	4-F	Me	H	CF_3	H	NO_2	H	Öl
112	2-F	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	99°
113	2,6-F_2	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	92°
114	2,6-F_2	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	122°
115	2,6-F_2	Me	H	CF_3	H	NO_2	H	120°
116	2,6-F_2	Me	H	NO_2	H	CO_2Et	H	168°
117	2,6-F_2	$-CH_2-CH=CH_2$	H	NO_2	H	CF_3	H	72°
118	2,6-F_2	$-CH_2-CH=CH_2$	H	NO_2	H	CF_3	Cl	
119	2,6-F_2	$-CH_2-CH=CH_2$	H	NO_2	H	CF_3	H	114°
120	2,6-F_2	$-CH_2-C\equiv CH$	H	NO_2	H	CF_3	Cl	Öl
121	3-Cl,4-F	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	
122	3-Cl,4-F	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	
123	4-CF_3	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	124°

续表 6

实例	R_n	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	Mp
124	4-CF_3	Me	H	CF_3	H	NO_2	H	108°
125	4-CF_3	Me	H	CF_3	Cl	NO_2	H	
126	4-CF_3	Me	H	NO_2	H	CO_2Et	H	150°
127	4-CF_3	Me	H	CF_3	H	CF_3		
128	4-CF_3	Me	-$SCCl_3$	NO_2	H	CF_3	Cl	
129	4-CF_3	Me	H	NO_2	H	CN	H	130°
130	4-CF_3	Me	H	NO_2	H	CN	Cl	109°
131	4-CF_3	Me	H	NO_2	H	OCF_3	H	63°
132	4-CF_3	Me	H	NO_2	Cl	CF_3	Cl	
133	4-CF_3	Me	Me	NO_2	H	CF_3	Cl	
134	4-CF_3	-CH_2-CH=CH_2	H	NO_2	H	CF_3	H	82°
135	4-CF_3	-CH_2-CH=CH_2	H	NO_2	H	CF_3	Cl	82°
136	4-CF_3	-CH_2-CH=CH_2	H	CF_3	H	NO_2	H	
137	4-CF_3	-$COCH_3$	H	NO_2	H	CF_3	H	142°
138	4-CF_3	-$COCH_3$	H	NO_2	H	CF_3	Cl	
139	4-CF_3	-$COCH_3$	H	CF_3	H	NO_2	H	
140	4-CF_3	-CH_2-C≡CH	H	NO_2	H	CF_3	H	106°
141	4-CF_3	-CH_2-C≡CH	H	NO_2	H	CF_3	Cl	118°
142	4-CF_3	-CH_2-C≡CH	H	CF_3	H	NO_2	H	114°
143	4-CF_3	-CH_2CN	H	NO_2	H	CF_3	H	106°
144	4-CF_3	-CH_2CN	H	NO_2	H	CF_3	Cl	131°
145	4-CF_3	-CF_2CHFCF_3	H	NO_2	H	CF_3	H	
146	4-CF_3	-CF_2CHFCF_3	H	NO_2	H	CF_3	Cl	Öl
147	4-CF_3	-CF_2CHFCF_3	H	CF_3	H	NO_2	H	
148	3-CF_3	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	118°
149	3-CF_3	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	122°
150	3-CF_3	Me	H	NO_2	H	CO_2Et	H	138°
151	3-CF_3	Me	H	CF_3	H	NO_2	H	105°
152	2-Cl,5-CF_3	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	98°
153	2-Cl,5-CF_3	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	93°
154	2-Cl,5-CF_3	Me	H	CF_3	H	NO_2	H	

续表 6

实例	R_n	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	Mp.
155	2-Cl,4-CF_3	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	76°
156	2-Cl,4-CF_3	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	116°
157	2-Cl,4-CF_3	Me	H	CF_3	H	NO_2	H	
158	2-Cl,4-CF_3	Me	H	NO_2	H	CN	H	
159	4-NO_2	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	
160	4-CN	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	193°
161	4-Me	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	117°
162	4-Me	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	136°
163	4-Me	Me	H	CF_3	H	NO_2	H	
164	4-Me	Me	H	NO_2	H	CO_2Et	H	136°
165	4-t-But	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	Öl
166	4-OCF_3	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	108°
167	4-OCF_3	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	88°
168	4-OCF_3	Me	H	CF_3	H	NO_2	H	
169	4-OMe	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	121°
170	4-OMe	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	120°
171	4-OMe	Me	H	CF_3	H	NO_2	H	
172	4-SMe	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	
173	4-SO_2Me	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	
174	4-SO_2Me	Me	H	CF_3	H	NO_2	H	
175	3-Cl	Me	H	CF_3	H	NO_2	H	Öl
176	4-Cl	-CF_2CHFCF_3	H	NO_2	H	CF_3	H	Öl
177	4-Cl	-$COCH_3$	H	NO_2	H	CF_3	H	110°
178	4-F	-$CH_2CH_2CH_3$	H	NO_2	H	CF_3	Cl	74°
179	2-F	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	Öl

续表6

实例	R_n	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	Mp.
180	4-Br	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	129°
181	4-Br	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	141°
182	4-Br	Me	H	CF_3	H	NO_2	H	113°
183	4-I	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	123°
184	4-I	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	110°
185	4-I	Me	H	CF_3	H	NO_2	H	122°
186	$2,4-F_2$	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	71°
187	$2,4-F_2$	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	88°
188	$2,4-F_2$	Me	H	CF_3	H	NO_2	H	Öl
189	$2,6-F_2$	$-CH_2-C\equiv CH$	H	NO_2	H	CF_3	H	114°
190	2-Cl,4-F	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	86°
191	2-Cl,4-F	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	102°
192	$4-CF_2Cl$	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	109°
193	$4-CF_2Cl$	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	64°
194	4-t-But	Me	H	NO_2	H	CF_3	H	Öl
195	$3,4-(OC_2H_5)_2$	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	105°

Me 为甲基

Et 为乙基

Oil为油状物

C．生物实例

例1

取播种约六星期的“Riesling / Ehrenfelder”的细幼苗，用本发明的化合物的水悬浮液处理直至其湿润到有水滴落。所应用浓度为每升喷洒液含活性化合物分别为500 ，250 和125 毫克或分别为500 和250 毫克。

在喷洒层干燥后，植物用 Plasmopara Viticola 的游动孢子囊悬浮液进行接种，将它放入一空气调节箱，温度约23℃而温度约为80～90% 。

植物在空气调节箱中放置过夜，培养7 天后，发生病害。于是估算受害程度。受害程度用叶面积的% 表示，并与感染过而未经处理的对照试样进行比较，见表7 和表8 。

表 7

依照实例编号的化合物	用每升含下列毫克数的活性化合物的喷洒液处理后感染的叶面积的%		
	500	250	125
43	0	0	0
3	0	0	0
44	0	0	0
55	0	0	0
57	0	0	0
58	0	0	0
59	0	0	0
31	0	0	0
95	0	0	0-3
123	0	0	0
96	0	0	0
2	0	5	15
114	0	0	0
162	0	0	0
4	0	0	0
受感染而未经处理的植物		100	

表 8

依照物例编号的化合物	用每升含下列毫克数的活性化合物的喷洒液处理后感染的叶面积的%	
	500	250
151	0	0
124	0	0
129	0	0
受感染而未经处理的植物	100	

例2

取3 叶龄的小麦植物用小麦霉(Erysiphe graminis) 的分生孢子使之严重地接种，然后放在20℃和相对温度为90～95% 的温室内。经过3天培养后，植物均匀地用表9 所列化合物的，浓度为按表中所列的溶液润湿。经过一次为期10天的培养后，仔细观察小麦霉对植物的侵袭。侵袭程度用感染叶面积与感染而未经处理的对照植物(= 100 % 侵袭) 相对比较的% 表示。结果见表9 。

表 9

依照实例编号的化合物	用每升喷洒液含下列毫克数的活性化合物的喷洒液处理后小麦霉感染的叶面积的%	
	500	250
95	0	10
123	0	0 ～5
受感染而未经处理的植物	100	

例3

取生长约6 星期的苹果(“Malus communis ”) 幼苗均匀地用表10中的活性化合物浓度液洒湿。在喷洒液层干燥后，植物均匀地用黑星菌(Venturie inaequalis) 的孢子悬浮液润湿，再放置黑暗的空气调节箱中在温度为20℃和100 % 相对温度下经48小时。然后将植物放置温度为15～17℃和约100 % 相对湿度的温室中。在培养经过大约2 星期后计算侵袭程度。植物业已受苹果黑菌侵袭的程度用感染过的叶面积相对于感染过而未经处理的对照植物的% 表示，见于表10。

表 10

依照实例编号的化合物	用每升喷洒液含下列毫克数活性化合物的喷洒液处理后黑星菌感染的叶面积的%		
	500	250	125
95	10	10	25
123	0	0	0 ~3
2	0	10	10
受感染而未经处理的植物		100	

例4

取约生长5 星期的稻子(Ballila) 的稻秧，用浓度为0.55% 的动物胶溶液预喷，然后用下表所列活性化合物进行处理。在喷洒液层干后，稻秧均匀地用梨孢霉(Piricularia oryzae) 的孢子悬浮液接种，然后放在温度为25℃和100 % 相对湿度的暗黑的空气调节箱中。经48小时后把稻秧放在温度为25℃和80% 相对温度的温室内。在5 天后计算侵袭程度。侵袭程度以感染过叶面积与感染的而未经处理的对照植物相比较的% 表示。结果综合列于表11。

表 11

依照实例编号的化合物	用每升含下列毫克数的活性化合物的喷洒液处理后梨孢霉感染的叶面积的%		
	500	250	125
95	10	10	25
96	15	15	25
2	0-3	0-3	5
受感染而未经处理的植物		100	

例5

取生长4 叶至5 叶的稻秧，用本发明的化合物并按表12所定的浓度将其处理。经24小时后喷洒层已干，稻秧放在加水的塑料罐中，将长满 Piricularia sasakii 的菌丝体稻颖混合物均匀地分布在水表面进行接种。然后将稻秧放在温室中，温度为25～30℃相对湿度至少为95% ，培养经一星期。侵袭程度以感染叶鞘与受感染而未经处理的对照植物相比较的% 表示。结果综合列于表12。

表 12

依照实例编号的化合物	用每升含下列毫克数的活性化合物喷洒液处理后菌感染过的稻秧的%		
	500	250	125
95	5	10	10
123	0	0	0
96	0-3	0-3	5
2	0	0	0
149	0	0	0
135	0	0	0
124	0	0	0
受感染而未经处理的植物		100	

例6

取2 叶龄的“ Jubilar”小麦，用本发明的化合物的水悬浮液处理，直到它滴湿。所用浓度为每升喷洒液含活性化合物500 ，250 ，125 和65毫克或每升含500 和250 毫克。

在喷洒液层干燥后，植物用柄锈菌(Puccinia recondita) 孢子水悬浮液接种。将它放进温度为20℃，相对湿度约100 % 的空气调节箱内约经16小时。受感染的植物然后放到温室中，温度为22～25℃，相对湿度为

50～70%。

在经过一个约2 星期的培养期后，未经处理的对照植物的整片叶表面已生成菌孢，因而这就可能对试验植物的侵袭度进行计算。侵袭程度用受感染的叶面积以% 表示，并与受感染而未经处理的对照植物相比较以% 表示。结果见表13和14。

表 13

依照实例编号的化合物	用每升喷洒液含下列毫克数活性化合物喷洒液处理后柄锈菌感染的叶面积的%			
	500	250	125	60
95	0	0	5	15
123	0	0	0	0-3
96	0	0	0	0-3
2	0	0	0	0
151	0	0	0	0
124	0	0	0	0
受感染而未经处理的植物			100	

表 14

依照实例编号的化合物	用每升喷洒液含下列毫克数活性化合物喷洒液处理后柄锈菌感染的叶面积的%	
	500	250
135	0	0
149	0	0
148	0	0
受感染而未经处理的植物		100

例7

豆科(Phaseolus V.) 植物严重地被红蜘蛛螨(Tetranychusuricae) 感染后，用一种含500 ppm 的合适活性化合物的可乳化浓缩液的水稀释液喷洒。经7 天后检查螨的死亡率，使用95，123 ，2 ，148 ，14 ，135 ，151 ，124 和140 的化合物杀灭效果可达到100 % 。

例8

被蚜虫(Aphis craccivora) 严重侵害的蚕豆(vicia faba) 主使用含1000ppm 活性化合物的可湿性粉浓缩物的水稀释液喷洒，直到水开始滴落阶段。经3 天后测定蚜虫的死亡率。使用95，123 ，151 和124 的化合物可杀灭蚜虫100 % 。

例9

将家蝇(Musca domesfica ，生长24小时）成虫放在经活性化合物理过的培养皿中。这些培养皿先前已在盖和底的内边用1 毫升活性化合物的水配制剂在每个皿中处理过，所用浓度为水中含250 ppm （ 活性化合物),在配制剂干后，将动物装入，盖上皿盖，在22℃保持3 小时。过后计数死蝇和测定死亡率。

发现在使用96，2 ，114 ，151 ，124 ，164 ，129 和113 的化合物，依照上述用药量可产生100 % 的死亡率。

例10

在培养皿中复涂一层人造营养物，当这饲糊变为固体时，皿底的内壁在每一试验都喷涂3 毫升含有活性化合物250 ppm 的水性乳化剂。在喷涂层已经干后，将10条普通棉虫(Prodenia litura ）的幼虫放入，培养皿在21℃时放置7 天，对每一化合物测定其杀虫效果(以死亡率% 表示）。在这试验中，化合物154 ，124 和129 每种都具有100 % 的杀虫活力。

例11

将一种浓度为250 ppm （ 活性化合物量）的水性乳化剂喷洒在豆(Phaseolus vulgaris）叶上，豆叶放在装有墨西哥豆甲虫的幼虫(Epilachna varivestis）的观察罩内，罩子已经按同样方法处理。经48小时后化合物151 和124 具有100 % 的杀灭效力。