



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 114641475 A

(43) 申请公布日 2022.06.17

(21) 申请号 202080063853.3

(22) 申请日 2020.09.11

(30) 优先权数据

2019-165792 2019.09.12 JP

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2022.03.11

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/JP2020/034387 2020.09.11

(87) PCT国际申请的公布数据

W02021/049595 JA 2021.03.18

(71) 申请人 日本农药株式会社

地址 日本东京都

(72) 发明人 山内千明 米村树 藤原弘和

(74) 专利代理机构 北京路浩知识产权代理有限公司 11002

专利代理师 张晶 谢顺星

(51) Int.Cl.

C07D 471/04 (2006.01)

C07D 413/14 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

A01N 43/836 (2006.01)

A61K 31/444 (2006.01)

A61K 31/4439 (2006.01)

A61P 33/10 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

A01P 7/02 (2006.01)

A01P 5/00 (2006.01)

A01P 9/00 (2006.01)

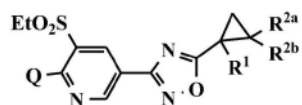
权利要求书1页 说明书41页

(54) 发明名称

以具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类为有效成分的农业园艺用杀虫剂或者动物用的外部或内部寄生虫防除剂、及其使用方法

(57) 摘要

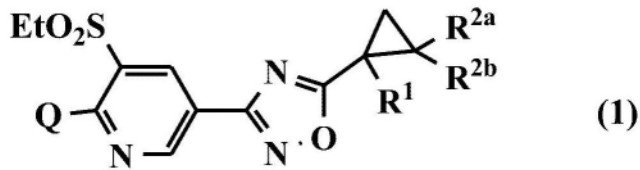
出于在农业及园艺等作物生产中由害虫等造成的灾害仍较大、对现有药物具有抗性的害虫的产生等主要原因,本发明的技术问题在于开发并提供一种新型的农业园艺用杀虫剂,以及提供一种动物用的驱除外部寄生虫或内部寄生虫的药剂。通过通式(1)所表示的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类,将该化合物或其盐类作为有效成分的农业园艺用杀虫剂、动物用内部或外部寄生虫防除剂、以及它们的使用方法,解决上述技术问题。



(I) 式中,优选R¹表

示烷基、R^{2a}及R^{2b}表示氢原子、R³表示卤代烷基、Q为咪唑并[4,5-b]吡啶。

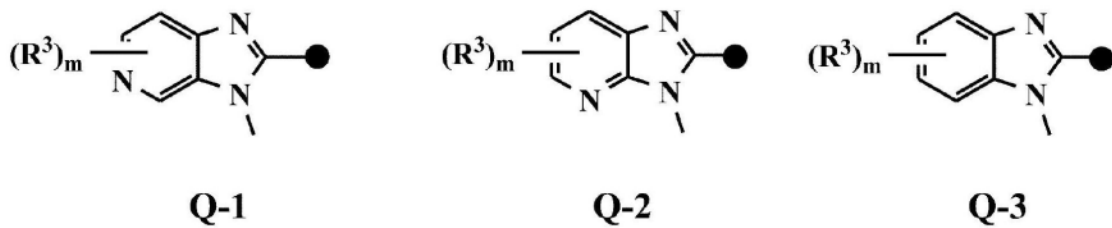
1. 一种通式 (1) 所表示的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类，
[化学式1]



式 (1) 中, R^1 、 R^{2a} 及 R^{2b} 任选相同或不同, R^1 、 R^{2a} 及 R^{2b} 表示 (a1) 氢原子、(a2) 卤原子、(a2) 氰基、(a3) (C_1-C_6) 烷基、(a4) 卤代 (C_1-C_6) 烷基或 (a5) 苯基, Et 基表示乙基,

Q 为下述 Q-1~Q-3 所表示的基团中的任一基团,

[化学式2]



式中, R^3 表示 (b1) 卤代 (C_1-C_6) 烷基、(b2) 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、(b3) 卤代 (C_1-C_6) 烷硫基、(b4) 卤代 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基或 (b5) 卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基, • 表示键合位置, m 表示 1 或 2。

2. 根据权利要求 1 所述的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类, 其中, R^1 为 (a3) (C_1-C_6) 烷基、(a4) 卤代 (C_1-C_6) 烷基或 (a5) 苯基, R^{2a} 及 R^{2b} 为 (a1) 氢原子, R^3 为 (b1) 卤代 (C_1-C_6) 烷基。

3. 根据权利要求 1 或 2 所述的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类, 其中, Q 为 Q-2。

4. 一种农业园艺用杀虫剂, 其特征在于, 其含有权利要求 1~3 中任一项所述的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类作为有效成分。

5. 一种农业园艺用杀虫剂的使用方法, 其特征在于, 以有效量的权利要求 1~3 中任一项所述的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类对植物或土壤进行处理。

6. 一种动物用的外部或内部寄生虫防除剂, 其特征在于, 其含有权利要求 1~3 中任一项所述的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类作为有效成分。

7. 一种动物用的外部或内部寄生虫防除剂的使用方法, 其特征在于, 以有效量的权利要求 1~3 中任一项所述的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类对动物进行经皮处理或口服给药。

以具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类为有效成分的农业园艺用杀虫剂或者动物用的外部或内部寄生虫防除剂、及其使用方法

技术领域

[0001] 本发明涉及以具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类为有效成分的农业园艺用杀虫剂或者动物用的外部或内部寄生虫防除剂、及它们的使用方法。

背景技术

[0002] 迄今为止,对作为农业园艺用杀虫剂的各种化合物进行了研究,有报告指出,某些种类的缩合杂环化合物能够用作杀虫剂(例如参照专利文献1~4)。这些文献中并未具体公开某些种类的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物。

现有技术文献

专利文献

[0003] 专利文献1:国际公开第2014/142292号册

专利文献2:国际公开第2016/104746号册

专利文献3:国际公开第2017/065183号册

专利文献4:国际公开第2017/146221号册

发明内容

本发明要解决的技术问题

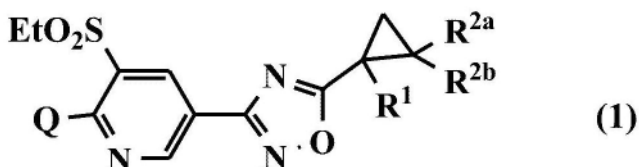
[0004] 在农业及园艺等作物生产中,由害虫等造成的灾害仍较大。因此,从对现有药物具有抗性的害虫的产生、对环境生物的影响、操作的省力化、确保操作者的安全性等角度出发,要求开发一种新型的农业园艺用杀虫剂,其具有优异的作用性,对天敌生物及益虫等非目标生物的影响少,具有内吸性,对包括人类在内的哺乳类的毒性轻,对鱼类及鸟类等环境生物的影响少,没有种间差异,被赋予了环境条件下的分解性得到担保的性质等优异的特性。此外,还要求开发一种动物用的防除外部或内部寄生虫的新型药剂。

解决技术问题的技术手段

[0005] 为了解决上述技术问题,本申请的发明人进行了认真研究,结果发现,通式(1)所表示的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类是一种不仅对农业园艺用害虫具有优异的防除效果,而且对天敌生物及益虫等非目标生物几乎没有影响,具有环境条件下的分解性得到担保的性质的极其有用的化合物,且发现该化合物能够防除动物的外部或内部寄生虫,本申请的发明人进一步进行研究,完成了本发明。

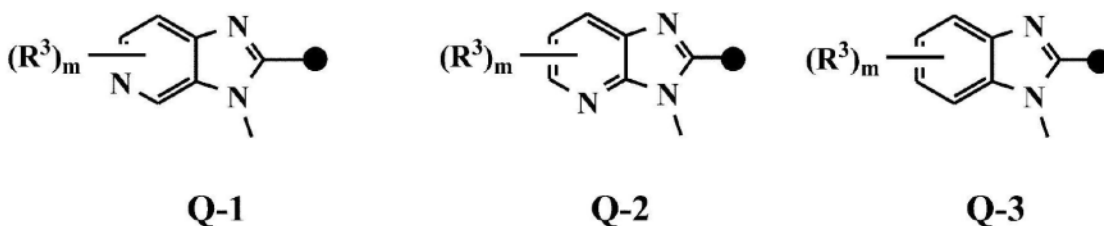
即,本发明涉及以下内容:

[1]一种通式(1)所表示的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类,
[化学式1]



式(1)中, R^1 、 R^{2a} 及 R^{2b} 任选相同或不同, R^1 、 R^{2a} 及 R^{2b} 表示(a1)氢原子、(a2)卤原子、(a2)氰基、(a3) (C_1-C_6) 烷基、(a4) 卤代 (C_1-C_6) 烷基或(a5) 苯基,Et基表示乙基, Q为下述Q-1~Q-3所表示的基团中的任一基团,

[化学式2]



式中, R^3 表示(b1) 卤代 (C_1-C_6) 烷基、(b2) 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基、(b3) 卤代 (C_1-C_6) 烷硫基、(b4) 卤代 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基或(b5) 卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基,•表示键合位置,m表示1或2。

[2]根据[1]所述的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类,其中, R^1 为(a3) (C_1-C_6) 烷基、(a4) 卤代 (C_1-C_6) 烷基或(a5) 苯基, R^{2a} 及 R^{2b} 为(a1) 氢原子, R^3 为(b1) 卤代 (C_1-C_6) 烷基。

[3]根据[1]或[2]所述的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类,其中,Q为Q-2。

[4]一种农业园艺用杀虫剂,其特征在于,其含有[1]~[3]中任一项所述的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类作为有效成分。

[5]一种农业园艺用杀虫剂的使用方法,其特征在于,以有效量的[1]~[3]中任一项所述的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类对植物或土壤进行处理。

[6]一种动物用的外部或内部寄生虫防除剂,其特征在于,其含有[1]~[3]中任一项所述的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类作为有效成分。

[7]一种动物用的外部或内部寄生虫防除剂的使用方法,其特征在于,以有效量的[1]~[3]中任一项所述的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类对动物进行经皮处理或口服给药。

发明效果

[0006] 本发明的化合物或其盐类不仅作为农业园艺用杀虫剂具有优异的效果,还对寄生在如狗、猫这样的玩赏动物或者牛、羊等家畜的体内或体外的害虫、白蚁等其他害虫具有驱除效果。

具体实施方式

[0007] 在本发明的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类的通式(1)的定义中,“卤代”是指“卤原子”,表示氯原子、溴原子、碘原子或氟原子。

[0008] “(C_1-C_6) 烷基”例如表示甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁

基、正戊基、异戊基、叔戊基、新戊基、2,3-二甲基丙基、1-乙基丙基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、正己基、异己基、2-己基、3-己基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、1,1,2-三甲基丙基、3,3-二甲基丁基等直链或支链状的碳原子数为1~6个的烷基。

[0009] “(C₁-C₆) 烷氧基”例如表示甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、正戊氧基、异戊氧基、叔戊氧基、新戊氧基、2,3-二甲基丙氧基、1-乙基丙氧基、1-甲基丁氧基、正己氧基、异己氧基、1,1,2-三甲基丙氧基等直链或支链状的碳原子数为1~6个的烷氧基。

[0010] “(C₁-C₆) 烷硫基”例如表示甲硫基、乙硫基、正丙硫基、异丙硫基、正丁硫基、仲丁硫基、叔丁硫基、正戊硫基、异戊硫基、叔戊硫基、新戊硫基、2,3-二甲基丙硫基、1-乙基丙硫基、1-甲基丁硫基、正己硫基、异己硫基、1,1,2-三甲基丙硫基等直链或支链状的碳原子数为1~6个的烷硫基。

“(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基”例如表示甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正丙基亚磺酰基、异丙基亚磺酰基、正丁基亚磺酰基、仲丁基亚磺酰基、叔丁基亚磺酰基、正戊基亚磺酰基、异戊基亚磺酰基、叔戊基亚磺酰基、新戊基亚磺酰基、2,3-二甲基丙基亚磺酰基、1-乙基丙基亚磺酰基、1-甲基丁基亚磺酰基、正己基亚磺酰基、异己基亚磺酰基、1,1,2-三甲基丙基亚磺酰基等直链或支链状的碳原子数为1~6个的烷基亚磺酰基。

“(C₁-C₆) 烷基磺酰基”例如表示甲基磺酰基、乙基磺酰基、正丙基磺酰基、异丙基磺酰基、正丁基磺酰基、仲丁基磺酰基、叔丁基磺酰基、正戊基磺酰基、异戊基磺酰基、叔戊基磺酰基、新戊基磺酰基、2,3-二甲基丙基磺酰基、1-乙基丙基磺酰基、1-甲基丁基磺酰基、正己基磺酰基、异己基磺酰基、1,1,2-三甲基丙基磺酰基等直链或支链状的碳原子数为1~6个的烷基磺酰基。

[0011] 上述“(C₁-C₆) 烷基”、“(C₁-C₆) 烷氧基”、“(C₁-C₆) 烷硫基”、“(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基”或“(C₁-C₆) 烷基磺酰基”的可进行取代位置,可以被1个或2个以上的卤原子取代,当取代的卤原子为2个以上时,卤原子可相同或不同。

[0012] 将上述被1个或2个以上的卤原子取代的取代基分别表示为“卤代(C₁-C₆) 烷基”、“卤代(C₁-C₆) 烷氧基”、“卤代(C₁-C₆) 烷硫基”、“卤代(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基”、“卤代(C₁-C₆) 烷基磺酰基”。在该技术领域,本发明中的取代基本身的意义及例示对本领域技术人员而言均是显而易见的。

[0013] “(C₁-C₆)”这一表述表示各种取代基的碳原子数的范围。

[0014] 作为本发明的通式(1)所表示的化合物的盐类,例如可例示出盐酸盐、硫酸盐、硝酸盐、磷酸盐等无机酸盐类;乙酸盐、富马酸盐、马来酸盐、草酸盐、甲磺酸盐、苯磺酸盐、对甲苯磺酸盐等有机酸盐类;与钠离子、钾离子、钙离子、三甲铵等无机或有机碱的盐类,但只要是作为农业园艺用药、兽药等害虫驱除药而可接受的盐类,则可以为任意盐类。

[0015] 对于本发明的通式(1)所表示的化合物及其盐类,其结构式中有时存在一个或多个手性中心,有时也存在两种以上的光学异构体,本发明包含全部的各种光学异构体及以任意比例含有它们的混合物。

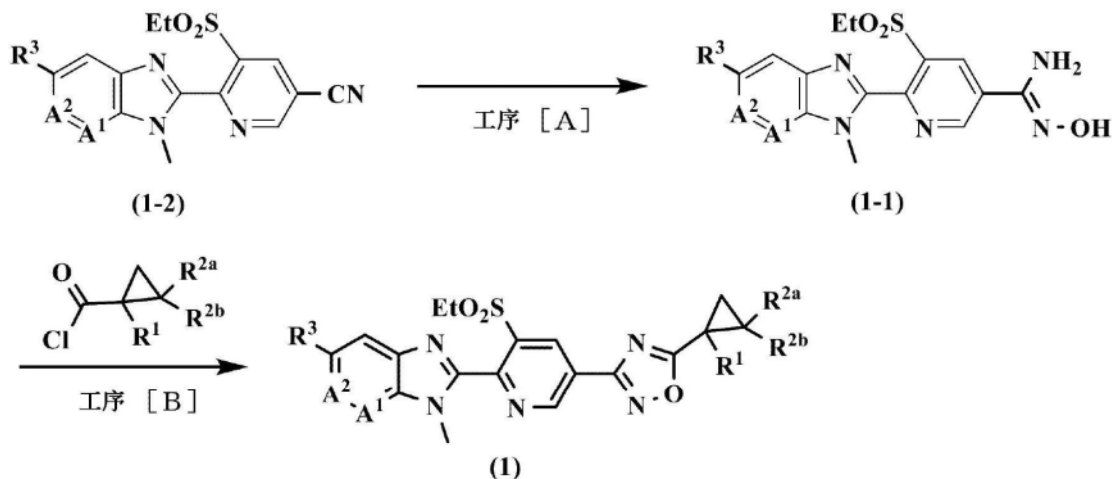
[0016] 在本发明的通式(1)所表示的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类中,优选R¹为(a3) (C₁-C₆) 烷基、(a4) 卤代(C₁-C₆) 烷基或(a5) 苯基,R^{2a}及R^{2b}为(a1) 氢原子,R³为(b1) 卤代(C₁-C₆) 烷基。进一步优选R¹为(a3) (C₁-C₆) 烷基、(a4) 卤代(C₁-C₆) 烷基或(a5)

苯基, R^{2a} 及 R^{2b} 为 (a1) 氢原子, R^3 为 (b1) 卤代 (C_1-C_6) 烷基, Q 为咪唑并 [4,5-b] 吡啶。

[0017] 本发明的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类例如可通过国际公开第2017/146221号册中记载的方法或下述制备方法进行制备,但本发明不限于这些制备方法。此外,本发明的制备方法中使用的中间化合物可直接使用市售品,或者也可通过公知的方法由市售品衍生。

[0018] 制备方法1

[化学式3]



式中, R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 及 R^3 与前述 R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 及 R^3 相同。

A^1 、 A^2 任选相同或不同, A^1 、 A^2 表示N或CH基,但不同时表示N。

[0019] 工序[A]的制备方法

通式 (1-1) 所表示的偕胺肟 (amidoxime) 化合物可通过在碱及惰性溶剂的存在下使通式 (1-2) 所表示的腈化合物与羟胺类进行反应而制备。

[0020] 作为在本反应中使用的碱,例如可列举出氢氧化钠、氢氧化钾、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠、碳酸氢钾等无机碱类;乙酸钠、乙酸钾等乙酸盐类;叔丁醇钾、甲醇钠、乙醇钠等碱金属醇盐类;三乙胺、二异丙基乙胺、1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯等叔胺类;吡啶、二甲基氨基吡啶等含氮芳香族化合物等,对于其用量,通常在相对于通式 (1-2) 所表示的化合物为1倍摩尔~10倍摩尔的范围内进行使用。

[0021] 作为在本反应中使用的羟胺类,例如可例示出羟胺盐酸盐、羟胺硫酸盐。

[0022] 作为在本反应中使用的惰性溶剂,只要不显著阻碍本反应的进行即可,例如可例示出苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类;二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等卤代脂肪族烃类;氯苯、二氯苯等卤代芳香族烃类;二乙醚、甲基叔丁醚 (MTBE)、二噁烷、四氢呋喃等链状或环状醚类;乙酸乙酯等酯类;二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺等酰胺类;丙酮、甲基乙基酮等酮类;二甲基亚砜、1,3-二甲基-2-咪唑啉酮、水等极性溶剂等的惰性溶剂,这些惰性溶剂可单独使用或混合使用两种以上。

[0023] 本反应为等摩尔反应,因此以等摩尔使用各反应物即可,但也可过量地使用任意一种反应物。反应温度可在室温至所使用的惰性溶剂的沸点区域内进行,反应时间因反应规模、反应温度而异,但在数分钟~48小时的范围内进行即可。反应结束后,通过常规方法从含有目标产物的反应系中分离目标产物即可,可根据需要通过再结晶、柱层析等进行纯化而制备目标产物。

[0024] 工序[B]的制备方法

通式(1)所表示的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物可通过在碱及惰性溶剂的存在下使通式(1-1)所表示的偕胺肟化合物与对应的酰氯或羧酸酐等进行反应而制备。

[0025] 作为在本反应中使用的碱,例如可列举出氢氧化钠、氢氧化钾、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠、碳酸氢钾等无机碱类;乙酸钠、乙酸钾等乙酸盐类;叔丁醇钾、甲醇钠、乙醇钠等碱金属醇盐类;三乙胺、二异丙基乙胺、1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯等叔胺类;吡啶、二甲基氨基吡啶等含氮芳香族化合物等,对于其用量,通常在相对于通式(1-1)所表示的化合物为1倍摩尔~10倍摩尔的范围内进行使用。

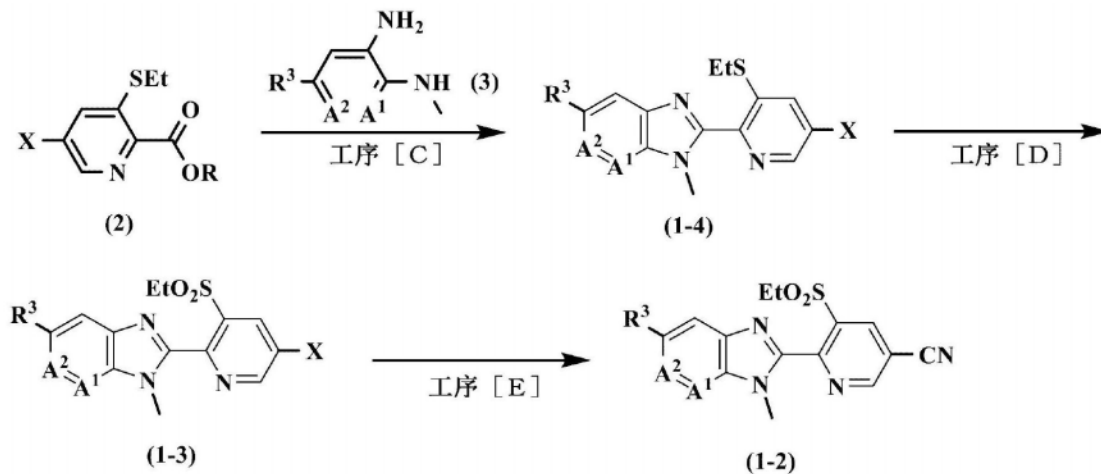
[0026] 作为在本反应中使用的惰性溶剂,只要不显著阻碍本反应的进行即可,例如可例示出苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类;二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等卤代脂肪族烃类;氯苯、二氯苯等卤代芳香族烃类;二乙醚、甲基叔丁醚、二噁烷、四氢呋喃等链状或环状醚类;乙酸乙酯等酯类;二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺等酰胺类;丙酮、甲基乙基酮等酮类;二甲基亚砜、1,3-二甲基-2-咪唑啉酮等极性溶剂等的惰性溶剂,这些惰性溶剂可单独使用或混合使用两种以上。

[0027] 反应温度可在室温(10℃至40℃)至所使用的惰性溶剂的沸点区域内进行,反应时间因反应规模、反应温度而异,但在数分钟~48小时的范围内进行即可。

反应结束后,通过常规方法从含有目标产物的反应系中分离目标产物即可,可根据需要通过再结晶、柱层析等进行纯化而制备目标产物。

[0028] 原料化合物(1-2)的制备方法

[化学式4]



式中, R³与前述R³相同, X表示卤原子, R表示C₁~C₃的烷基。

A¹、A²任选相同或不同, A¹、A²表示N或CH基, 但不同时表示N。

[0029] 工序[C]的制备方法

通式(1-4)所表示的咪唑并吡啶化合物、或苯并咪唑可通过以下方法进行制备:在碱及惰性溶剂的存在下,使按照国际公开第2016/121997号册中记载的方法制备的通式(2)所表示的羧酸酯与按照国际公开第2014/142292号册中记载的方法制备的通式(3)所表示的吡啶化合物或苯化合物进行反应,得到酰胺中间体。分离或不分离该中间体,在酸性条件下进行闭环反应。

[0030] 作为在本闭环反应中使用的碱,例如可列举出氢氧化钠、氢氧化钾、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠、碳酸氢钾等无机碱类;乙酸钠、乙酸钾等乙酸盐类;叔丁醇钾、甲醇钠、乙醇钠等碱金属醇盐类;三乙胺、二异丙基乙胺、1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯等叔胺类;吡啶、二甲基氨基吡啶等含氮芳香族化合物等,对于其用量,通常在相对于通式(2)所表示的化合物为1倍摩尔~10倍摩尔的范围内进行使用。

[0031] 作为在本闭环反应中使用的惰性溶剂,只要不显著阻碍本反应的进行即可,例如可例示出苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类;二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等卤代脂肪族烃类;氯苯、二氯苯等卤代芳香族烃类;二乙醚、甲基叔丁醚、二噁烷、四氢呋喃等链状或环状醚类;乙酸乙酯等酯类;二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺等酰胺类;丙酮、甲基乙基酮等酮类;二甲基亚砜、1,3-二甲基-2-咪唑啉酮等极性溶剂等的惰性溶剂,这些惰性溶剂可单独使用或混合使用两种以上。

[0032] 本闭环反应为等摩尔反应,因此以等摩尔使用各反应物即可,但也可过量地使用任意一种反应物。反应温度可在室温至所使用的惰性溶剂的沸点区域内进行,反应时间因反应规模、反应温度而异,但在数分钟~48小时的范围内进行即可。反应结束后,通过从反应系中分离或不分离中间体并在酸及惰性溶剂的存在下进行反应,可制备酰胺中间体。

[0033] 作为在本闭环反应中使用的酸,例如可例示出盐酸、硫酸、硝酸等无机酸;甲酸、乙酸、丙酸、三氟乙酸、苯甲酸等有机酸;甲磺酸、三氟甲磺酸等磺酸;磷酸等,对于其用量,只要在相对于通式(2)所表示的化合物为0.01倍摩尔~10倍摩尔的范围内适当选择、使用即可。

[0034] 作为在本闭环反应中使用的惰性溶剂,只要不显著阻碍本反应的进行即可,例如可例示出苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类;二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等卤代脂肪族烃类;氯苯、二氯苯等卤代芳香族烃类;二乙醚、甲基叔丁醚、二噁烷、四氢呋喃等链状或环状醚类;乙酸乙酯等酯类;二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺等酰胺类;丙酮、甲基乙基酮等酮类;二甲基亚砜、1,3-二甲基-2-咪唑啉酮等极性溶剂等的惰性溶剂,这些惰性溶剂可单独使用或混合使用两种以上。反应结束后,通过常规方法从含有目标产物的反应系中分离目标产物即可,可根据需要通过再结晶、柱层析等进行纯化而制备目标产物。

[0035] 工序[D]的制备方法

通过在惰性溶剂中使通式(1-4)所表示的咪唑并吡啶化合物或苯并咪唑化合物与氧化剂进行反应,可制备通式(1-3)所表示的咪唑并吡啶化合物或苯并咪唑化合物。

[0036] 作为在本反应中使用的氧化剂,可列举出双氧水、过苯甲酸、间氯过氧苯甲酸等的过氧化物等。这些氧化剂可在相对于通式(1-4)所表示的咪唑并吡啶化合物或苯并咪唑化合物为1倍摩尔~10倍摩尔的范围内进行适当选择。

[0037] 作为可在本反应中使用的惰性溶剂,只要不显著阻碍本反应的进行即可,例如可例示出二乙醚、四氢呋喃、二噁烷等链状或环状醚类;苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类;二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等卤代脂肪族烃类;氯苯、二氯苯等卤代芳香族烃类;乙腈等腈类;乙酸乙酯等酯类;甲酸、乙酸等有机酸类;N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、1,3-二甲基-2-咪唑啉酮、水等极性溶剂,这些惰性溶剂可单独使用或混合使用两种以上。

[0038] 本反应的反应温度只需在-10℃至所使用的惰性溶剂的回流温度的范围内适当选择即可。反应时间因反应规模、反应温度等而变化,因而不定,但在数分钟~48小时的范围

内适当选择即可。反应结束后,通过常规方法从含有目标产物的反应系中分离目标产物即可,可根据需要通过再结晶、柱层析等进行纯化而制备目标产物。

[0039] 工序[E]的制备方法

通式(1-2)所表示的咪唑并吡啶化合物或苯并咪唑化合物可通过所谓的罗森蒙德-冯布劳恩反应(Rosenmund-von Braun reaction) (Ber.Dtsch.Chem.Ges.1919,52,1749),在惰性溶剂的存在下使通式(1-3)所表示的咪唑并吡啶与氰化合物进行反应而制备。

[0040] 作为可在本反应中使用的氰化合物,可列举出氰化钠、氰化钾、氰化锌、氰化铜等。

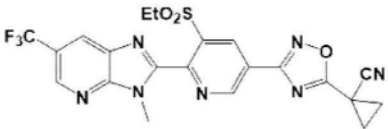
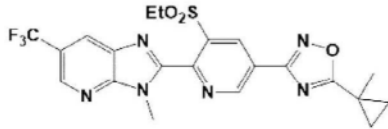
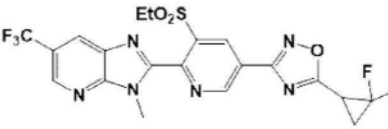
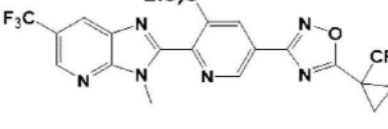
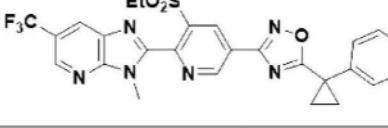
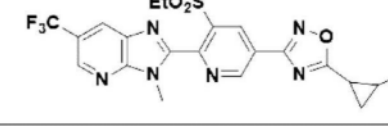
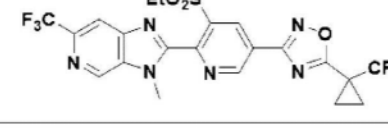
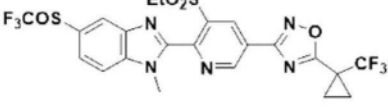
[0041] 作为可在本反应中使用的惰性溶剂,只要不显著阻碍本反应即可,例如可例示出苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类;二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等卤代脂肪族烃类;氯苯、二氯苯等卤代芳香族烃类;吡啶等芳香族杂环类,这些惰性溶剂可单独使用或混合使用两种以上。

[0042] 本反应的反应温度通常在约0℃至所使用的溶剂的沸点的范围内进行即可,反应时间因反应规模、反应温度而异,但在数分钟~48小时的范围内适当选择即可。可在本反应中使用的氰化合物通常在相对于通式(1-3)所表示的咪唑并吡啶化合物或苯并咪唑化合物为约1倍摩尔~5倍摩尔的范围内使用。反应结束后,通过常规方法从含有目标产物的反应系中分离目标产物即可,可根据需要通过再结晶、柱层析等进行纯化而制备目标产物。

[0043] 然后,以下示出本发明化合物的具体例。物性表示熔点(℃)。

[0044] [表1]

第1表

化合物编号	结构	物性值
1-1		
1-2		144-145
1-3		
1-4		151-152
1-5		176-178
1-6		150-151
1-7		177-179
1-8		140-141

[0045] 含有本发明的通式(1)所表示的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类作为有效成分的农业园艺用杀虫剂,适合防除对水稻、果树、蔬菜、其他作物及花卉类造成灾害的各种农林、园艺、贮粮害虫、卫生害虫或者线虫类等害虫。

[0046] 作为鳞翅目(Lepidoptera)害虫,例如可列举出绿刺蛾(*Parasa consocia*)、桥夜蛾(*Anomis mesogona*)、柑橘凤蝶(*Papilio xuthus*)、日豆小卷蛾(*Matsumuraeses azukivora*)、麻田豆秆野螟(*Ostrinia scapulalis*)、莎草粘虫(*Spodoptera exempta*)、美国白蛾(*Hyphantria cunea*)、亚洲玉米螟(*Ostrinia furnacalis*)、东方粘虫(*Pseudaletia separata*)、衣蛾(*Tinea translucens*)、尖翅小卷蛾(*Bactra furfuryla*)、直纹稻弄蝶(*Parnara guttata*)、稻显纹刷须野螟(*Marasmia exigua*)、直纹稻弄蝶(*Parnara guttata*)、大螟(*Sesamia inferens*)、甘薯麦蛾(*Brachmia triannulella*)、黄刺蛾(*Monema flavescens*)、粉斑夜蛾(*Trichoplusia ni*)、苧麻肋野螟蛾(*Pleuroptya ruralis*)、小蜻蜓

尺蛾 (*Cystidia couaggaria*)、亮灰蝶 (*Lampides boeticus*)、咖啡透翅天蛾 (*Cephonodes hylas*)、棉铃虫 (*Helicoverpa armigera*)、曼蚕舟蛾 (*Phalerodonta manleyi*)、大避债蛾 (*Eumeta japonica*)、天幕毛虫 (*Malacosoma neustria testacea*)、柿举肢蛾 (*Stathmopoda masinissa*)、柿细蛾 (*Cuphodes diospyrosella*)、柞黄卷蛾 (*Archips xylosteanus*)、黄地老虎 (*Agrotis segetum*)、甘蔗黄螟 (*Tetramoera schistaceana*)、黄凤蝶 (*Papilio machaon hippocrates*)、黄斑蝙蝠蛾 (*Endoclyta sinensis*)、银纹潜叶蛾 (*Lyonetia prunifoliella*)、金纹小潜细蛾 (*Phyllonorycter ringoneella*)、栗白小卷蛾 (*Cydia kurokoi*)、栗绿小卷蛾 (*Eucoenogenes aestuosa*)、葡萄花翅小卷蛾 (*Lobesia botrana*)、中国绿刺蛾 (*Latoia sinica*)、皮暗斑螟 (*Euzophera batangensis*)、慈菇褐纹卷蛾 (*Phalonidia mesotypa*)、桑斑雪灯蛾 (*Spilosoma imparilis*)、桑绢野螟 (*Glyphodes pyloalis*)、桑卷叶蛾 (*Olethreutes mori*)、幕谷蛾 (*Tineola bisselliella*)、蝙蝠蛾 (*Endoclyta excrescens*)、谷蛾 (*Nemapogon granellus*)、苹果透翅蛾 (*Synanthedon hector*)、苹果小卷蛾 (*Cydia pomonella*)、小菜蛾 (*Plutella xylostella*)、稻纵卷叶野螟 (*Cnaphalocrocis medinalis*)、蛀茎夜蛾 (*Sesamia calamistis*)、三化螟 (*Scirpophaga incertulas*)、兰草螟蛾 (*Pediasia teterrellus*)、马铃薯块茎蛾 (*Phthorimaea operculella*)、苹蚁舟蛾 (*Stauropus fagi persimilis*)、豆荚螟 (*Etiella zinckenella*)、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua*)、白斑蝙蝠蛾 (*Palpifer sexnotata*)、灰翅夜蛾 (*Spodoptera mauritia*)、稻白螟 (*Scirpophaga innotata*)、八字地老虎 (*Xestia c-nigrum*)、淡剑纹灰翅夜蛾 (*Spodoptera depravata*)、地中海斑螟 (*Ephestia kuehniella*)、李尺蛾 (*Angerona prunaria*)、分月扇舟蛾 (*Clostera anastomosis*)、大豆夜蛾 (*Pseudoplusia includens*)、松村氏捲蛾 (*Matsumuraeses falcana*)、烟实夜蛾 (*Helicoverpa assulta*)、黑点丫纹夜蛾 (*Autographa nigrisigna*)、球菜夜蛾 (*Agrotis ipsilon*)、茶黄毒蛾 (*Euproctis pseudoconspersa*)、棉褐带卷蛾 (*Adoxophyes orana*)、茶细蛾 (*Caloptilia theivora*)、茶长卷蛾 (*Homona magnanima*)、烟草粉斑螟 (*Ephestia elutella*)、茶避债蛾 (*Eumeta minuscula*)、杨扇舟蛾 (*Clostera anachoreta*)、亚麻夜蛾 (*Heliothis maritima*)、葡萄长须卷蛾 (*Sparganothis pilleriana*)、亚澳白裙夜蛾 (*Busseola fusca*)、东方毒蛾 (*Euproctis subflava*)、褐纹大尺蛾 (*Biston robustum*)、玉米夜蛾 (*Heliothis zea*)、甘薯烦夜蛾 (*Aedia leucomelas*)、梨娜刺蛾 (*Narosoides flavidorsalis*)、梨剑纹夜蛾 (*Viminia rumicis*)、梨角折蛾 (*Bucculatrix pyrivorella*)、梨小食心虫 (*Grapholita molesta*)、梨潜皮细蛾 (*Spulerina astaurota*)、果外髓斑螟 (*Ectomyelois pyrivorella*)、二化螟 (*Chilo suppressalis*)、葱菜蛾 (*Acrolepiopsis sapporensis*)、印度谷螟 (*Plodia interpunctella*)、菜心野螟 (*Hellula undalis*)、麦蛾 (*Sitotroga cerealella*)、斜纹夜蛾 (*Spodoptera litura*)、绿豆芽蛾类 (*Eucosma aporema*)、草莓长翅卷蛾 (*Acleris comariana*)、灰齿刺蛾 (*Scopelodes contractus*)、旋古毒蛾 (*Orgyia thyellina*)、草地夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*)、*Ostrinia zaguliaevi*、双带夜蛾 (*Naranga aenescens*)、茶蚕蛾 (*Andraca bipunctata*)、葡萄透翅蛾 (*Paranthrene regalis*)、缺角天蛾 (*Acosmeryx castanea*)、葡萄潜叶蛾 (*Phyllocnistis toparcha*)、葡萄浆果蛾 (*Endopiza viteana*)、环针单纹蛾 (*Eupoecillia ambiguella*)、黎豆夜蛾 (*Anticarsia gemmatalis*)、*Cnephasia cinereipalpana*、舞毒蛾 (*Lymantria dispar*)、赤

松毛虫 (*Dendrolimus spectabilis*)、大豆食心虫 (*Leguminivora glycinivorella*)、豆荚野螟 (*Maruca testulalis*)、豆小卷蛾 (*Matsumuraeses phaseoli*)、大豆丽细蛾 (*Caloptilia soyella*)、柑桔叶潜蛾 (*Phyllocnistis citrella*)、豆啮叶野螟 (*Omiodes indicata*)、杏黄卷蛾 (*Archips fuscocupreanus*)、银纹夜蛾 (*Acanthopplusia agnata*)、桑蓑蛾 (*Bambalina* sp.)、桃蛀果蛾 (*Carposina niponensis*)、桃蛀螟 (*Conogethes punctiferalis*)、樟兴透翅蛾类 (*Synanthedon* sp.)、桃潜蛾 (*Lyonetia clerkella*)、小黄斑粉蝶 (*Papilio helenus*)、斑缘豆粉蝶 (*Colias erate poliographus*)、苹掌舟蛾 (*Phalera flavescens*)、大菜粉蝶 (*Pieris brassicae*)、小菜粉蝶日本亚种 (*Pieris rapae crucivora*) 等粉蝶类、桑毛虫 (*Euproctis similis*)、点线锦织蛾 (*Acrolepiopsis suzukiella*)、欧洲玉米螟 (*Ostrinia nubilalis*)、甘蓝夜蛾 (*Mamestra brassicae*)、大造桥虫 (*Ascotis selenaria*)、艾草大细卷叶蛾 (*Phtheochroides clandestina*)、北川卷蛾 (*Hoshinoa adumbratana*)、圆斑黄枯叶蝶 (*Odonestis pruni japonensis*)、苹剑纹夜蛾 (*Triaena intermedia*)、苹小卷叶蛾 (*Adoxophyes orana fasciata*)、苹小食心虫 (*Grapholita inopinata*)、苹白小卷蛾 (*Spilonota ocellana*)、顶梢卷叶蛾 (*Spilonota lechriaspis*)、梨星毛虫 (*Illiberis pruni*)、苹果银蛾 (*Argyresthia conjugella*)、猛花细蛾 (*Caloptilia zachrysa*)、梨黄卷蛾 (*Archips breviplicanus*)、小造桥夜蛾 (*Anomis flava*)、棉红铃虫 (*Pectinophora gossypiella*)、棉大卷叶野螟 (*Notarcha derogata*)、瓜绢野螟 (*Diaphania indica*)、烟芽夜蛾 (*Heliothis virescens*) 及鼎点钻夜蛾 (*Earias cupreoviridis*) 等。

[0047] 作为半翅目 (*Hemiptera*) 害虫,例如可列举出稻绿椿 (*Nezara antennata*)、赤条纤盲蝽 (*Stenotus rubrovittatus*)、黑条红椿象 (*Graphosoma rubrolineatum*)、条赤须盲蝽 (*Trigonotylus coelestialium*)、黄伊缘蝽 (*Aeschynoteles maculatus*)、*Creontiades pallidifer*、赤星椿象 (*Dysdercus cingulatus*)、褐圆介壳虫 (*Chrysomphalus ficus*)、肾圆盾蚧 (*Aonidiella aurantii*)、油蝉 (*Graptopsaltria nigrofuscata*)、麦长蝽 (*Blissus leucopterus*)、吹绵蚧 (*Icerya purchasi*)、壁椿 (*Piezodorus hybneri*)、稻褐蝽 (*Lagnotomus elongatus*)、白翅叶蝉 (*Thaia subrufa*)、稻黑蝽 (*Scotinophara lurida*)、玫瑰蚜 (*Sitobion ibarae*)、*Stariodes iwasakii*、椰圆盾蚧 (*Aspidiotus destructor*)、苍白泰盲蝽 (*Taylorilygus pallidulus*)、杏瘤蚜 (*Myzus mumecola*)、梅白蚧 (*Pseudaulacaspis prunicola*)、豌豆蚜 (*Acyrtosiphon pisum*)、纹须同缘椿象 (*Anacanthocoris striicornis*)、跃盲蝽 (*Ectometopterus micantulus*)、日本二星棒 (*Eysarcoris lewisi*)、巨叶足虫 (*Molipteryx fuliginosa*)、大青叶蝉 (*Cicadella viridis*)、红腹缢管蚜 (*Rhopalosiphum rufiabdominalis*)、黑蜡蚧 (*Saissetia oleae*)、温室粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*)、橡木叶蝉 (*Aguriahana quercus*)、盲蝽类 (*Lygus* spp.)、桦绵斑蚜 (*Euceraphis punctipennis*)、柑橘介壳虫 (*Andaspis kashicola*)、橘软蜡蚧 (*Coccus pseudomagnoliarum*)、甘蔗异背长蝽 (*Cavelerius saccharivorus*)、菊贝脊网蝽 (*Galeatus spinifrons*)、菊小长管蚜 (*Macrosiphoniella sanborni*)、黄圆蹄盾蚧 (*Aonidiella citrina*)、茶翅蝽 (*Halyomorpha mista*)、樟网蝽 (*Stephanitis fasciicarina*)、樟木虱 (*Trioza camphorae*)、中稻缘蝽 (*Leptocoris chinensis*)、*Trioza quercicola*、黄角肩网蝽 (*Uhlerites latius*)、葡萄伴斑叶蝉 (*Erythroneura comes*)、长蝽

(*Paromius exiguus*)、柘柳重圆盾蚧(*Duplaspidiotus claviger*)、二条斑黑尾叶蝉(*Nephotettix nigropictus*)、庭园盲蝽(*Halticiellus insularis*)、甘蔗扁角飞虱(*Perkinsiella saccharicida*)、苹果木虱(*Psylla malivorella*)、桑木虱(*Anomomeura mori*)、长尾粉蚧(*Pseudococcus longispinis*)、桑白盾蚧(*Pseudaulacaspis pentagona*)、桑绵蜡蚧(*Pulvinaria kuwacola*)、绿盲蝽(*Apolygus lucorum*)、葫芦长蝽(*Togo hemipterus*)、桔二叉蚜(*Toxoptera aurantii*)、糖粉蚧(*Saccharicoccus sacchari*)、蔗根蚜(*Geoica lucifuga*)、瓶额飞虱(*Numata muii*)、梨圆介壳虫(*Comstockaspis perniciososa*)、桔矢尖盾蚧(*Unaspis citri*)、茄沟无网蚜(*Aulacorthum solani*)、广二星蝽(*Eysarcoris ventralis*)、银叶粉虱(*Bemisia iaargentifolii*)、大白叶蝉(*Cicadella spectra*)、春藤圆盾蚧(*Aspidiotus hederæ*)、粟缘蝽(*Liorhyssus hyalinus*)、黑背丽木虱(*Calophya nigridorsalis*)、白背稻虱(*Sogatella furcifera*)、空豆髭长油虫(*Megoura crassicauda*)、甘蓝蚜(*Brevicoryne brassicae*)、大豆蚜(*Aphis glycines*)、稻斑腹蛛缘蝽(*Leptocorisa oratorius*)、二点黑尾叶蝉(*Nephotettix virescens*)、莴苣指管蚜(*Uroeucon formosanum*)、烟盲蝽(*Cyrtopeltis tenuis*)、烟粉虱(*Bemisia tabaci*)、桃蜡蚧(*Lecanium persicae*)、茶糠蚧(*Parlatoria theae*)、牡丹网纹盾蚧(*Pseudoaonidia paeoniae*)、大贯小绿叶蝉(*Empoasca onukii*)、褐翅绿椿象(*Plautia stali*)、百合西圆尾蚜(*Dysaphis tulipae*)、大戟长管蚜(*Macrosiphum euphorbiae*)、杜鹃冠网蝽(*Stephanitis pyrioides*)、角蜡蚧(*Ceroplastes ceriferus*)、山茶糠蚧(*Parlatoria camelliae*)、淡娇异蝽(*Apolygus spinolai*)、黑尾叶蝉(*Nephotettix cincticeps*)、青蝽(*Glaucias subpunctatus*)、杂毛合垫盲蝽(*Orthotylus flavosparsus*)、玉米蚜(*Rhopalosiphum maidis*)、玉米蜡蝉(*Peregrinus maidis*)、二星蝽(*Eysarcoris parvus*)、温带臭虫(*Cimex lectularius*)、冷杉木虱(*Psylla abietis*)、褐飞虱(*Nilaparvata lugens*)、海桐木虱(*Psylla tobirae*)、皱纹菜蝽(*Eurydema rugosum*)、梨二叉蚜(*Schizaphis piricola*)、梨黄木虱(*Psylla pyricola*)、梨星片盾蚧(*Parlatoreopsis pyri*)、梨冠网蝽(*Stephanitis nashi*)、水松粉蚧(*Dysmicoccus wistariae*)、梨蚧(*Lepholeucaspis japonica*)、梨园尾蚜(*Sappaphis piri*)、萝卜蚜(*Lipaphis erysimi*)、中国台湾韭蚜、莲缢管蚜(*Rhopalosiphum nymphæae*)、蔷薇小叶蝉(*Edwardsiana rosae*)、苏铁褐点盾蚧(*Pinnaspis aspidistrae*)、赤杨木虱(*Psylla alni*)、叶蝉(*Speusotettix subfuscus*)、杂食性叶蝉(*Alnetoidia alneti*)、稗飞虱(*Sogatella panicola*)、苜蓿盲蝽(*Adelphocoris lineolatus*)、联斑棉红蝽(*Dysdercus poecilus*)、黑片盾蚧(*Parlatoria ziziphi*)、褐角肩网蝽(*Uhlerites debile*)、灰飞虱(*Laodelphax striatella*)、六斑菜蝽(*Eurydema pulchrum*)、长肩棘缘椿象(*Cletus trigonus*)、一点铲头沫蝉(*Clovio punctata*)、小绿叶蝉类(*Empoasca sp.*)、褐软蜡蚧(*Coccus hesperidum*)、草鼓胸长蝽(*Pachybrachius luridus*)、藤臀纹粉蚧(*Planococcus kraunhiae*)、双斑盲蝽(*Stenotus binotatus*)、葡萄阿小叶蝉(*Arboridia apicalis*)、二点叶蝉(*Macrosteles fascifrons*)、斑须蝽(*Dolycoris baccarum*)、三环苜蓿盲蝽(*Adelphocoris triannulatus*)、葡萄根瘤蚜(*Viteus vitifolii*)、瘤缘椿象(*Acanthocoris sordidus*)、大稻缘蝽(*Leptocorisa acuta*)、瘤腹巨股长蝽(*Macropes obnubilus*)、稻棘缘蝽(*Cletus punctiger*)、点蜂缘椿象(*Riptortus clavatus*)、番茄木虱(*Paratrioza cockerelli*)、柳

尖胸沫蝉 (*Aphrophora costalis*)、日本草盲蝽 (*Lygus disponsi*)、东亚草盲蝽 (*Lygus saundersi*)、松白粉蚧 (*Crisicoccus pini*)、松小叶蝉 (*Empoasca abietis*)、松粉蚧 (*Crisicoccus matsumotoi*)、豆蚜 (*Aphis craccivora*)、臭蝽 (*Megacopta punctatissimum*)、圆白星椿象 (*Eysarcoris guttiger*)、紫疤蚜盾蚧 (*Lepidosaphes beckii*)、柑桔木虱 (*Diaphorina citri*)、桔蚜 (*Toxoptera citricidus*)、柑桔粉蚧 (*Planococcus citri*)、柑橘粉虱 (*Dialeurodes citri*)、黑刺粉虱 (*Aleurocanthus spiniferus*)、柑橘小粉蚧 (*Pseudococcus citriculus*)、*Zyginella citri*、桔绵蜡蚧 (*Pulvinaria citricola*)、偏软蜡蚧 (*Coccus discrepans*)、蛇眼臀网盾蚧 (*Pseudaonidia duplex*)、柑橘绵蚧 (*Pulvinaria aurantii*)、东方球蜡蚧 (*Lecanium corni*)、稻绿蝽 (*Nezara viridula*)、二刺狭盲蝽 (*Stenodema calcaratum*)、禾谷缢管蚜 (*Rhopalosiphum padi*)、麦长管蚜 (*Sitobion akebiae*)、麦二叉蚜 (*Schizaphis graminum*)、*Sorhoanus tritici*、光管舌尾蚜 (*Brachycaudus helichrysi*)、紫翅果蝽 (*Carpocoris purpureipennis*)、桃蚜 (*Myzus persicae*)、桃大尾蚜 (*Hyalopterus pruni*)、柳蚜 (*Aphis farinose yanagicola*)、杨柳网蝽 (*Metasalis populi*)、矢尖盾蚧 (*Unaspis yanonensis*)、芙蓉木虱 (*Mesohomotoma camphorae*)、绣线菊蚜 (*Aphis spiraeicola*)、苹果蚜 (*Aphis pomi*)、榆蚜盾蚧 (*Lepidosaphes ulmi*)、苹木虱 (*Psylla mali*)、苹叶盲蝽 (*Heterocordylus flavipes*)、苹果瘤蚜 (*Myzus malisuctus*)、苹果蚜虫 (*Aphidonuguis mali*)、苹果叶蝉 (*Orientus ishidai*)、苹果蚜 (*Ovatus malicolens*)、苹绵蚜 (*Eriosoma lanigerum*)、红蜡蚧 (*Ceroplastes rubens*) 及棉蚜 (*Aphis gossypii*) 等。

[0048] 作为鞘翅目 (*Coleoptera*) 害虫, 例如可列举出合欢双条天牛 (*Xystrocera globosa*)、毒隐翅虫 (*Paederus fuscipes*)、金边青花金龟 (*Eucetonia roelofsi*)、绿豆象 (*Callosobruchus chinensis*)、甘薯小象 (*Cylas formicarius*)、紫苜蓿叶象 (*Hypera postica*)、稻象甲 (*Echinocnemus squameus*)、水稻负泥虫 (*Oulema oryzae*)、水稻负泥虫 (*Oulema oryzae*)、长腿水叶甲 (*Donacia provosti*)、稻水象甲 (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、甘薯叶甲 (*Colasposoma dauricum*)、西印度甘薯象甲 (*Euscepes postfasciatus*)、墨西哥豆瓢虫 (*Epilachna varivestis*)、菜豆象 (*Acanthoscelides obtectus*)、玉米根叶甲 (*Diabrotica virgifera virgifera*)、李蓝卷象 (*Involvulus cupreus*)、黄守瓜 (*Aulacophora femoralis*)、豌豆象 (*Bruchus pisorum*)、马铃薯瓢虫 (*Epilachna vigintioctomaculata*)、脊胸露尾甲 (*Carpophilus dimidiatus*)、甜菜大龟甲 (*Cassida nebulosa*)、粗背寡毛跳甲 (*Luperomorpha tenebrosa*)、黄曲条菜跳甲 (*Phyllotreta striolata*)、黄星天牛 (*Psacotheta hilaris*)、黄斑天牛 (*Aeolesthes chrysothrix*)、蒙栎象 (*Curculio sikkimensis*)、酱曲露尾甲 (*Carpophilus hemipterus*)、小青花金龟 (*Oxycetonia jucunda*)、根萤叶甲类 (*Diabrotica spp.*)、亮绿彩丽金龟 (*Mimela splendens*)、玉米象 (*Sitophilus zeamais*)、赤拟谷盗 (*Tribolium castaneum*)、米象 (*Sitophilus oryzae*)、亚扁粉盗 (*Palorus subdepressus*)、日本豆金龟 (*Melolontha japonica*)、星天牛 (*Anoplophora malasiaca*)、大点拟粉虫 (*Neatus picipes*)、马铃薯叶甲 (*Leptinotarsa decemlineata*)、黄瓜十一星叶甲食根亚种 (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、猎象 (*Sphenophorus venatus*)、十四点负泥虫 (*Crioceris quatuordecimpunctata*)、梅球颈象 (*Conotrachelus nenuphar*)、大根猿象虫

(*Ceuthorrhynchidius albosuturalis*)、小猿叶虫(*Phaedon brassicae*)、烟草甲(*Lasioderma serricorne*)、日本根瘤象(*Sitona japonicus*)、斑喙丽金龟(*Adoretus tenuimaculatus*)、面粉甲虫(*Tenebrio molitor*)、*Basilepta balyi*、小车轴草叶象甲(*Hypera nigrirostris*)、甜菜跳甲(*Chaetocnema concinna*)、大绿丽金龟(*Anomala cuprea*)、黑七鳃金龟(*Heptophylla picea*)、茄二十八星瓢虫(*Epilachna vigintioctopunctata*)、长角叶甲(*Diabrotica longicornis*)、*Eucetonia pilifera*、叩甲类(*Agriotes* spp.)、黑毛皮蠹(*Attagenus unicolor japonicus*)、斑鞘豆叶甲(*Pagria signata*)、红铜丽金龟(*Anomala rufocuprea*)、姬帕谷甲(*Palorus ratzeburgii*)、褐菌虫(*Alphitobius laevigatus*)、地毯甲虫(*Anthrenus verbasci*)、褐粉蠹(*Lyctus brunneus*)、杂拟谷盗(*Tribolium confusum*)、黑条麦萤叶甲(*Medythia nigrobilineata*)、葡萄脊虎天牛(*Xylotrechus pyrrhoderus*)、黄瓜跳甲(*Epitrix cucumeris*)、纵坑切梢小蠹(*Tomicus piniperda*)、松墨天牛(*Monochamus alternatus*)、日本弧丽金龟(*Popillia japonica*)、豆芫青(*Epicauta gorhami*)、玉米象(*Sitophilus zeamais*)、日本苹虎象(*Rhynchites heros*)、蔬菜叶象甲(*Listroderes costirostris*)、四纹豆象(*Callosobruchus maculatus*)、苹霜绿切叶象(*Phyllobius armatus*)、苹果开花象鼻虫(*Anthonomus pomorum*)、铜绿里叶甲(*Linnaeidea aenea*)及墨西哥棉铃象(*Anthonomus grandis*)等。

[0049] 作为双翅目(Diptera)害虫,例如可列举出淡色库蚊(*Culex pipiens pallens*)、甜菜潜叶蝇(*Pegomya hyoscyami*)、南美斑潜蝇(*Liriomyza huidobrensis*)、家蝇(*Musca domestica*)、稻秆蝇(*Chlorops oryzae*)、稻心蝇(*Hydrellia sasakii*)、日本稻潜蝇(*Agromyza oryzae*)、姬稻潜叶蝇(*Hydrellia griseola*)、麦叶毛眼水蝇(*Hydrellia griseola*)、菜豆蛇潜蝇(*Ophiomyia phaseoli*)、瓜实蝇(*Dacus cucurbitae*)、樱桃果蝇(*Drosophila suzukii*)、日本樱桃实蝇(*Rhacochlaena japonica*)、厩腐蝇(*Muscina stabulans*)、东亚异蚤蝇(*Megaselia spiracularis*)等蚤蝇类、毛蠓(*Clogmia albipunctata*)、稻大蚊(*Tipula aino*)、伏蝇(*Phormia regina*)、三带喙库蚊(*Culex tritaeniorhynchus*)、中华按蚊(*Anopheles sinensis*)、甘蓝地种蝇(*Hylemya brassicae*)、大豆荚瘿蝇(*Asphondylia* sp.)、灰地种蝇(*Delia platura*)、葱地种蝇(*Delia antiqua*)、樱桃绕实蝇(*Rhagoletis cerasi*)、地下家蚊(*Culex pipiens molestus* Forsk.)、地中海实蝇(*Ceratitis capitata*)、黑翅蕈蝇(*Bradysia agrestis*)、肖藜泉蝇(*Pegomya cunicularia*)、美洲斑潜蝇(*Liriomyza sativae*)、番茄斑潜蝇(*Liriomyza bryoniae*)、豌豆彩潜蝇(*Chromatomyia horticola*)、葱斑潜蝇(*Liriomyza chinensis*)、致倦库蚊(*Culex quinquefasciatus*)、埃及伊蚊(*Aedes aegypti*)、白纹伊蚊(*Aedes albopictus*)、三叶斑潜蝇(*Liriomyza trifolii*)、美洲斑潜蝇(*Liriomyza sativae*)、东方果实蝇(*Dacus dorsalis*)、蜜柑大实蝇(*Dacus tsuneonis*)、麦红吸浆虫(*Sitodiplosis mosellana*)、黑腹麦秆蝇(*Meromuza nigriventris*)、墨西哥按实蝇(*Anastrepha ludens*)及苹果实蝇(*Rhagoletis pomonella*)等。

[0050] 作为膜翅目(Hymenoptera)害虫,例如可列举出短刺棱胸切叶蚁(*Pristomyrmex pungens*)、肿腿蜂类(*Bethylid* wasps)、法老蚁(*Monomorium pharaonis*)、宽节大头蚁(*Pheidole noda*)、菜叶蜂(*Athalia rosae*)、栗瘿蜂(*Dryocosmus kuriphilus*)、日本黑褐

蚁 (*Formica fusca japonica*)、胡蜂类 (*Vespid wasps*)、黑背白萝卜叶蜂 (*Athalia infumata infumata*)、月季叶蜂 (*Arge pagana*)、日本芜菁叶蜂 (*Athalia japonica*)、切叶蚁 (*Acromyrmex spp.*)、火蚁 (*Solenopsis spp.*)、苹果三节叶蜂 (*Arge mali*) 及光滑管琉璃蚁 (*Ochetellus glaber*) 等。

[0051] 作为直翅目 (*Orthoptera*) 害虫, 例如可列举出南方稻草螽 (*Homorocoryphus lineosus*)、蝼蛄 (*Gryllotalpa sp.*)、小稻蝗 (*Oxya hyla intricata*)、小翅稻蝗 (*Oxya yezoensis*)、飞蝗 (*Locusta migratoria*)、短翅稻蝗 (*Oxya japonica*)、北方水稻螽斯 (*Homorocoryphus jezoensis*) 及黄脸油葫芦 (*Teleogryllus emma*) 等。

[0052] 作为缨翅目害虫, 例如可列举出红带滑胸针蓟马 (*Selenothrips rubrocinctus*)、稻蓟马 (*Stenchaetothrips biformis*)、稻管蓟马 (*Haplothrips aculeatus*)、*Ponticulothrips diospyrosi*、黄蓟马 (*Thrips flavus*)、玉米黄呆蓟马 (*Anaphothrips obscurus*)、佛州樟蓟马 (*Liothrips floridensis*)、唐菖蒲筒蓟马 (*Thrips simplex*)、菊黑毛蓟马 (*Thrips nigropilosus*)、温室蓟马 (*Heliothrips haemorrhoidalis*)、桑蓟马 (*Pseudodendrothrips mori*)、腹小头蓟马 (*Microcephalothrips abdominalis*)、帕氏毛管蓟马 (*Leeuwenia pasanii*)、*Litotetothrips pasaniae*、柑橘蓟马 (*Scirtothrips citri*)、华筒管蓟马 (*Haplothrips chinensis*)、豆喙蓟马 (*Mycterothrips glycines*)、毛蓟马 (*Thrips setosus*)、茶黄蓟马 (*Scirtothrips dorsalis*)、茶棍蓟马 (*Dendrothrips minowai*)、黑角筒管蓟马 (*Haplothrips niger*)、烟蓟马 (*Thrips tabaci*)、葱蓟马 (*Thrips alliorum*)、黄胸蓟马 (*Thrips hawaiiensis*)、豆筒管蓟马 (*Haplothrips kurdjumovi*)、袖指蓟马 (*Chirothrips manicatus*)、花蓟马 (*Frankliniella intonsa*)、日本蓟马 (*Thrips coloratus*)、西花蓟马 (*Frankliniella occidentalis*)、棕榈蓟马 (*Thrips palmi*)、百合蓟马 (*Frankliniella lilivora*) 及百合滑管蓟马 (*Liothrips vaneckei*) 等。

[0053] 作为蜱螨目害虫, 例如可列举出红纤沙螨 (*Leptotrombidium akamushi*)、卢氏叶螨 (*Tetranychus ludeni*)、变异革蜱 (*Dermacentor variabilis*)、截形叶螨 (*Tetranychus truncatus*)、柏氏禽刺螨 (*Ornithonyssus bacoti*)、犬蠕形螨 (*Demodex canis*)、山楂叶螨 (*Tetranychus viennensis*)、神泽氏叶螨 (*Tetranychus kanzawai*)、血红扇头蜱 (*Rhipicephalus sanguineus*) 等硬蜱类、马六甲肉食螨 (*Cheyletus malaccensis*)、腐食酪螨 (*Tyrophagus putrescentiae*)、粉剂螨 (*Dermatophagoides farinae*)、红背蜘蛛 (*Latrodectus hasseltii*)、中国台湾革蜱、茶尖叶节蜱 (*Acaphylla theavagrans*)、侧多食跗线螨 (*Polyphagotarsonemus latus*)、番茄刺皮瘿螨 (*Aculops lycopersici*)、森林姬刺螨 (*Ornithonyssus sylviarum*)、二斑叶螨 (*Tetranychus urticae*)、中国瘿螨 (*Eriophyes chibaensis*)、人疥螨 (*Sarcoptes scabiei*)、长角血蜱 (*Haemaphysalis longicornis*)、有胛硬蜱 (*Ixodes scapularis*)、似食酪螨 (*Tyrophagus similis*)、普通肉食螨 (*Cheyletus eruditus*)、柑桔全爪螨 (*Panonychus citri*)、莫氏肉食螨 (*Cheyletus moorei*)、紫红短须螨 (*Brevipalpus phoenicis*)、犬猫耳螨 (*Octodectes cynotis*)、欧洲室尘螨 (*Dermatophagoides ptrenyssnus*)、褐黄血蜱 (*Haemaphysalis flava*)、卵形硬蜱 (*Ixodes ovatus*)、*Phyllocoptruta citri*、苹刺瘿螨 (*Aculus schlechtendali*)、苹果全爪螨 (*Panonychus ulmi*)、美洲花蜱 (*Amblyomma americanum*) 及鸡皮刺螨 (*Dermanyssus gallinae*)、罗宾根螨 (*Rhyzoglyphus robini*)、生卡螨类 (*Sancassania sp.*) 等。

[0054] 作为等翅目害虫,例如可列举出*Reticulitermes miyatakei*、小楹白蚁(*Incisitermes minor*)、家白蚁(*Coptotermes formosanus*)、日本湿木蚁(*Hodotermopsis japonica*)、散白蚁(*Reticulitermes sp.*)、黄胸散白蚁(*Reticulitermes flaviceps amamianus*)、*Glyptotermes kushimensis*、广州乳白蚁(*Coptotermes guangzhoensis*)、恒春新白蚁(*Neotermes koshunensis*)、*Glyptotermes kodamai*、赤树白蚁(*Glyptotermes satsumensis*)、截头堆砂白蚁(*Cryptotermes domesticus*)、黑翅土白蚁(*Odontotermes formosanus*)、*Glyptotermes nakajimai*、近扭白蚁(*Pericapritermes nitobei*)及栖北散白蚁(*Reticulitermes speratus*)等。

[0055] 作为蜚蠊目害虫,例如可列举出黑胸大蠊(*Periplaneta fuliginosa*)、德国小蠊(*Blattella germanica*)、东方蠊(*Blatta orientalis*)、密西西比黑蠊(*Periplaneta brunnea*)、拟德国小蠊(*Blattella lituricollis*)、日本大蠊(*Periplaneta japonica*)及美洲大蠊(*Periplaneta americana*)等。

[0056] 作为蚤目,例如可列举出人蚤(*Pulex irritans*)、猫栉头蚤(*Ctenocephalides felis*)及鸡蚤(*Ceratophyllus gallinae*)等。

[0057] 作为线虫类,例如可列举出草莓芽线虫(*Nothotylenchus acris*)、水稻干尖线虫(*Aphelenchoides besseyi*)、穿刺短体线虫(*Pratylenchus penetrans*)、北方根结线虫(*Meloidogyne hapla*)、南方根瘤线虫(*Meloidogyne incognita*)、罗斯托克异皮线虫(*Globodera rostochiensis*)、爪哇根结线虫(*Meloidogyne javanica*)、大豆胞囊线虫(*Heterodera glycines*)、咖啡短体线虫(*Pratylenchus coffeae*)、落选短体线虫(*Pratylenchus neglectus*)及柑桔半穿刺线虫(*Tylenchus semipenetrans*)等。

[0058] 作为软体动物类,例如可列举出福寿螺(*Pomacea canaliculata*)、非洲大蜗牛(*Achatina fulica*)、双线蛞蝓(*Meghimatium bilineatum*)、查科蛞蝓(*Lehmannina valentiana*)、黄蛞蝓(*Limax flavus*)及螺蛳(*Acusta despecta sieboldiana*)等。

[0059] 此外,本发明的农业园艺用杀虫剂对作为其他害虫的番茄潜叶蛾(*Tuta absoluta*)也具有强力的杀虫效果。

[0060] 此外,作为为防除对象之一的寄生在动物的体内或体外的动物寄生性的蜱螨,例如可列举出如微小牛蜱(*Boophilus microplus*)、血红扇头蜱(*Rhipicephalus sanguineus*)、长角血蜱(*Haemaphysalis longicornis*)、褐黄血蜱(*Haemaphysalis flava*)、铃头血蜱(*Haemaphysalis campanulata*)、嗜群血蜱(*Haemaphysalis concinna*)、日本血蜱(*Haemaphysalis japonica*)、北岗血蜱(*Haemaphysalis kitaokai*)、*Haemaphysalis ias*、卵形硬蜱(*Ixodes ovatus*)、日本硬蜱(*Ixodes nipponensis*)、全沟硬蜱(*Ixodes persulcatus*)、龟形花蜱(*Amblyomma testudinarium*)、巨棘血蜱(*Haemaphysalis megaspinoza*)、网纹革蜱(*Dermacentor reticulatus*)及中国台湾革蜱这样的硬蜱类,如鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*)、森林姬刺螨(*Ornithonyssus sylviarum*)及囊形刺脂螨(*Ornithonyssus bursa*)这样的禽刺螨类,如危鸡犹沙螨(*Eutrombicula wichmanni*)、红纤沙螨(*Leptotrombidium akamushi*)、苍白纤恙螨(*Leptotrombidium pallidum*)、富士纤恙螨(*Leptotrombidium fuji*)、土佐纤恙螨(*Leptotrombidium tosa*)、秋恙螨(*Neotrombicula autumnalis*)、阿[耳弗雷杜热斯]氏真恙螨(*Eutrombicula alfreddugesi*)及宫川合轮螨(*Helenicula miyagawai*)这样的恙虫

类,如牙氏姬螯螨(*Cheyletiella yasguri*)、寄食姬螯螨(*Cheyletiella parasitivorax*)及布氏姬螯螨(*Cheyletiella blakei*)这样的肉食螨类,如兔痒螨(*Psoroptes cuniculi*)、牛皮痒螨(*Chorioptes bovis*)、耳痒螨(*Otodectes cynotis*)、人疥螨(*Sarcoptes scabiei*)及猫疥癣虫(*Notoedres cati*)这样的疥癣类,以及如犬蠕形螨(*Demodex canis*)这样的蠕形螨类等。

[0061] 作为为其他防除对象的跳蚤,例如可列举出属于蚤目(*Siphonaptera*)的外部寄生性无翅昆虫,更具体而言,可列举出属于人蚤科(*Pulicidae*)及鼠蚤科(*Ceratophyllus*)等的跳蚤类。作为属于人蚤科的跳蚤类,例如可列举出犬栉头蚤(*Ctenocephalides canis*)、猫栉头蚤(*Ctenocephalides felis*)、人蚤(*Pulex irritans*)、禽角头蚤(*Echidnophaga gallinacea*)、印鼠客蚤(*Xenopsylla cheopis*)、缓慢细蚤(*Leptopsylla segnis*)、具带病蚤(*Nosopsyllus fasciatus*)及不等单蚤(*Monopsyllus anisus*)等。

[0062] 进一步,作为为其他防除对象的外部寄生虫,例如可列举出如牛血虱(*Haematopinus eurysternus*)、驴血虱(*Haematopinus asini*)、羊虱(*Dalmanina ovis*)、牛颞虱(*Linognathus vituli*)、猪血虱(*Haematopinus suis*)、阴虱(*Phthirus pubis*)及头虱(*Pediculus capitis*)这样的虱类,以及如犬啮毛虱(*Trichodectes canis*)这样的啮毛虱类,如三角虻(*Tabanus trigonus*)、尖喙库蠓(*Culicoides schultzei*)及装饰短蚋(*Simulium ornatum*)这样的吸血性双翅目害虫等。此外,作为内部寄生虫,例如可列举出如肺虫、鞭虫、结节虫、胃内寄生虫、蛔虫及丝虫类这样的线虫类,如曼氏裂头绦虫、阔节裂头绦虫、犬复孔绦虫、多头绦虫、细粒棘球绦虫及多房棘球绦虫这样的绦虫类,如日本血吸虫及肝片吸虫这样的吸虫类,以及如球虫、疟原虫、肠内肉孢子虫、弓形虫及隐孢子虫这样的原生动物等。

[0063] 更详细而言,作为内部寄生虫,例如可列举出属于嘴刺目(*Enoplida*)寄生虫:鞭虫亚属(鞭虫)(*Trichuris* spp.)、毛细线虫亚属(毛细线虫)(*Capillaria* spp.)、*Trichomosoides*亚属、旋毛虫亚属(旋毛虫属)(*Trichinella* spp.)、小杆目(*Rhabditia*)、例如细丝鲶亚属(*Micronema* spp.)、类圆线虫亚属(*Strongyloides* spp.)、圆线虫目(*Strongylida*)、例如圆形线虫亚属(圆线虫)(*Strongylus* spp.)、三齿线虫亚属(*Triodontophorus* spp.)、食管齿线虫亚属(*Oesophagodontus* spp.)、毛线线虫亚属(*Trichonema* spp.)、辐首线虫亚属(*Gyalocephalus* spp.)、柱咽线虫亚属(*Cylindropharynx* spp.)、杯口线虫亚属(*Poteriostomum* spp.)、*Cyclococercus*亚属、杯冠线虫亚属(*Cylicostephanus* spp.)、结节线虫亚属(结节线虫属)(*Oesophagostomum* spp.)、夏柏特线虫亚属(*Chabertia* spp.)、有齿冠尾线虫亚属(猪肾虫)(*Stephanurus* spp.)、钩口线虫亚属(十二指肠钩虫)(*Ancylostoma* spp.)、钩虫亚属(*Uncinaria* spp.)、仰口线虫亚属(*Bunostomum* spp.)、球头线虫亚属(*Globocephalus* spp.)、比翼线虫亚属(交合线虫)(*Syngamus* spp.)、杯口线虫亚属(*Cyathostoma* spp.)、后圆线虫亚属(肺虫)(*Metastrongylus* spp.)、网尾线虫亚属(*Dictyocaulus* spp.)、缪勒线虫亚属(*Muellerius* spp.)、原圆线虫亚属(*Protostrongylus* spp.)、新圆线虫亚属(*Neoststrongylus* spp.)、囊尾线虫亚属(*Cystocaulus* spp.)、肺圆线虫亚属(*Pneumoststrongylus* spp.)、尖尾线虫亚属(*Spicocaulus* spp.)、鹿圆线虫亚属(*Elaphoststrongylus* spp.)、副鹿圆线虫亚属(*Parelaphoststrongylus* spp.)、环体线虫亚属(*Crenosoma* spp.)、副环体线虫亚属

(*Parelaphostrongylus* spp.)、住血线虫亚属(住血线虫) (*Angiostrongylus* spp.)、猫圆线虫亚属(*Aelurostrongylus* spp.)、类丝虫亚属(*Filaroides* spp.)、副类丝虫亚属(*Parafilaroides* spp.)、毛圆线虫亚属(毛圆线虫) (*Trichostrongylus* spp.)、血矛线虫亚属(捻转胃虫) (*Haemonchus* spp.)、胃线虫亚属(*Ostertagia* spp.)、马歇尔线虫亚属(*Marshallagia* spp.)、古柏线虫亚属(*Cooperia* spp.)、细颈线虫亚属(线虫) (*Nematodirus* spp.)、猪圆线虫亚属(*Hyostrongylus* spp.)、尖柱线虫亚属(*Obeliscoides* spp.)、裂口线虫亚属(*Amidostomum* spp.)、盘头线虫亚属(*Ollulanus* spp.)等的内部寄生虫、

[0064] 属于尖尾目(*Oxyurida*) 寄生虫:尖尾线虫亚属(马蛲虫) (*Oxyuris* spp.)、住肠线虫亚属(蛲虫) (*Enterobius* spp.)、栓尾线虫亚属(*Passalurus* spp.)、管状线虫亚属(*Syphacia* spp.)、无刺线虫亚属(*Aspiculuris* spp.)、异刺线虫亚属(*Heterakis* spp.)等的内部寄生虫、

[0065] 属于蛔虫目(*Ascaridia*) 寄生虫:蛔虫亚属(蛔虫) (*Ascaris* spp.)、弓蛔线虫亚属(*Toxascaris* spp.)、弓蛔虫亚属(狗蛔虫) (*Toxocara* spp.)、副蛔虫亚属(马蛔虫) (*Parascaris* spp.)、异尖线虫亚属(*Anisakis* spp.)、鸡蛔虫亚属(蛔虫) (*Ascaridia* spp.)、旋尾目(旋尾线虫类) (*Spirurida*)、例如颚口虫亚属(颚口线虫) (*Gnathostoma* spp.)、泡翼线虫亚属(*Physaloptera* spp.)、吸吮线虫亚属(*Thelazia* spp.)、筒线虫亚属(*Gongylonema* spp.)、丽线虫亚属(*Habronema* spp.)、副柔线虫亚属(*Parabronema* spp.)、德拉西线虫亚属(*Draschia* spp.)、龙线虫亚属(龙线虫) (*Dracunculus* spp.)等的内部寄生虫、

[0066] 属于丝虫目(*Filariida*):冠丝虫亚属(*Stephanofilaria* spp.)、副丝虫亚属(*Parafilaria* spp.)、鬃丝虫亚属(*Setaria* spp.)、罗阿丝虫亚属(*Loa* spp.)、恶丝虫亚属(犬恶丝虫) (*Dirofilaria* spp.)、光丝虫亚属(*Litomosoides* spp.)、马来丝虫亚属(*Brugia* spp.)、吴策线虫亚属(丝虫) (*Wuchereria* spp.)、盘尾丝虫亚属(*Onchocerca* spp.)等的内部寄生虫、

[0067] 属于巨吻棘头虫目(*Gigantorhynchida*):细颈棘头虫亚属(*Filicollis* spp.)、念珠棘头虫亚属(*Moniliformis* spp.)、巨吻棘头虫亚属(*Macracanthorhynchus* spp.)或前睾棘头虫亚属(*Prosthenorchis* spp.)等的内部寄生虫。

[0068] 以本发明的通式(1)所表示的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类为有效成分的外部或内部寄生虫防除剂不仅对栖息于中间宿主及终宿主的体内的寄生虫表现出效果,还对保虫宿主生物体内的寄生虫也表现出效果。此外,本发明的通式(1)所表示的化合物或其盐类在寄生虫的所有发育阶段发挥效果。例如,对于原虫类而言,对包囊、前包囊型(*precystic form*)、营养型或无性生殖期的分裂体、阿米巴体、有性生殖期的生殖母体、生殖体、融合子、孢子体等发挥效果。对于线虫类而言,对卵、幼虫、成虫发挥效果。此外,本发明的化合物不仅可驱除生物体内的寄生虫,还可通过施用于成为感染途径的环境中来预防性地防止内部或外部寄生虫的感染。例如,可提前预防来自于旱田、公园的土壤的土壤传播感染;来自于河川、湖沼、湿地、水田等水系的经皮感染;来自于狗、猫等动物的粪便的经口感染;来自于海水鱼、淡水鱼、甲壳类、贝类、家畜的生肉等的经口感染;来自于蚊、虻、苍蝇、蟑螂、螨、跳蚤、虱、猎蝽、恙虫等的感染等。

[0069] 对在哺乳动物及鸟类中的应用进行说明。将本发明的化合物用于哺乳动物及鸟类的外部或内部寄生虫的防除时,可通过口服给药;注射(肌内、皮下、静脉、腹腔)等非口服给药;浸渍、喷雾、入浴、洗涤、浇泼(pouring-on)及滴(spotting-on)以及撒粉(dusting)等经皮给药或鼻腔给药,一并给药有效量的本发明的化合物与制剂用添加物。本发明的化合物还可以通过条、板、带、颈圈、耳标(ear mark)、肢带(limb band)、使用有标记装置等的成型品而进行给药。在给药时,可将本发明的化合物制成适合于给药途径的任意剂型。

[0070] 作为本发明的化合物的任意剂型,可列举出粉剂、颗粒剂、可湿性粉剂、丸剂、片剂、巨丸剂、胶囊剂、其他含有本发明的化合物的成型品等固体制备物;注射用液体制剂、口服用液体制剂、用于动物皮肤或体腔中的液体制剂(例如,浇泼(Pour-on)剂、滴(Spot-on)剂);乳剂等水溶性或油性的液体制备物、胶悬剂等混悬状制备物;软膏剂、凝胶等半固体制备物等。

固体制备物主要可用于口服给药、或者利用水等进行稀释而用于经皮给药、又或者可用于环境处理。固体制备物可通过将本发明的化合物与适当的赋形剂一起混合而制成所需的形状,从而进行制备,必要时还可加入辅助剂。作为适当的赋形剂,例如可例示出碳酸盐、碳酸氢盐、磷酸盐、氧化铝、二氧化硅、黏土等无机物、糖、纤维素、经粉碎的谷物、淀粉等有机物。

[0071] 注射用液体制剂可静脉、肌内及皮下给药,可通过使本发明的化合物溶解于适当的溶剂中,并根据需要加入增溶剂、酸、碱、缓冲盐、抗氧化剂及保护剂等添加剂,从而制备注射用液体制剂。作为适当的溶剂,可列举出水、乙醇、丁醇、苄醇、丙三醇、丙二醇、聚乙二醇、N-甲基吡咯烷酮以及它们的混合物、生理学上可接受的植物油、适合于注射的合成油等。作为增溶剂,可列举出聚乙烯吡咯烷酮、经聚氧乙基化的蓖麻油及经聚氧乙基化的山梨糖醇酐酯等。保护剂有苄醇、三氯丁醇、对羟基苯甲酸酯及正丁醇等。

[0072] 口服液体制剂可直接给药或在稀释后给药。此外,口服液体制剂与注射用液体制剂相同,可通过现有的已充分确立的制剂技术进行制备。

[0073] 胶悬剂、乳剂等可直接经皮给药或在稀释后经皮给药,或者在不危害环境的情况下方便地进行给药。

[0074] 适合在动物的皮肤上应用的液体制剂,可通过浇泼、平敷、擦揉、喷雾、散布而进行给药,或者通过浸渍(浸渍、入浴或洗涤)或涂布而进行给药。这些液体制剂可以以与注射用液体制剂相同的方式进行制备。

[0075] 浇泼(Pour-on)剂及滴(Spot-on)剂可通过在动物皮肤的限定位置进行浇泼或喷雾,使本发明的化合物渗透至动物的皮肤而作用于全身。浇泼剂及滴剂可通过将有效成分溶解、混悬或乳化于适合于适当的动物皮肤的溶剂或溶剂混合物而制备。必要时,可加入表面活性剂、着色剂、吸收促进剂、抗氧化剂、消泡剂、光稳定剂及粘合剂等辅助剂,作为溶剂,可列举出水、烷醇、甘醇、聚乙二醇、聚丙二醇、丙三醇、苄醇、苯基乙醇、苯氧基乙醇、乙酸乙酯、乙酸丁酯、苯甲酸苄酯、二丙二醇单甲醚、二乙二醇单丁醚、丙酮、甲基乙基酮、芳香族和/或脂肪族烃、植物或合成油、DMF(二甲基甲酰胺)、液体石蜡、轻质液体石蜡、有机硅、二甲基乙酰胺、N-甲基吡咯烷酮或2,2-二甲基-4-氧基亚甲基-1,3-二氧戊环。作为吸收促进剂,可列举出DMSO(二甲基亚砷)、肉豆蔻酸异丙酯、丙二醇二壬酸酯、硅油、脂肪族酯、甘油三酯及脂肪醇。作为抗氧化剂的实例,可列举出亚硫酸盐、偏亚硫酸氢盐、抗坏血酸、丁基羟

基甲苯、丁基羟基苯甲醚及生育酚等。

[0076] 乳剂可以口服给药、经皮给药或以注射的形式进行给药。乳剂可通过将有效成分溶解于疏水性相或亲水性相,并利用适当的乳化剂将其与另一相的溶剂进行均质化而制备,必要时可将其与着色剂、吸收促进剂、保护剂、抗氧化剂、遮光剂及增稠物质等辅助剂一同与另一相的溶剂进行均质化。

[0077] 作为疏水性相(油)的实例,可列举出石蜡油、硅油、芝麻油、杏仁油、蓖麻油、合成甘油三酯、中链脂肪酸甘油三酯(辛酸(C₈)、癩酸(C₁₀)等的甘油三酯等)、硬脂酸乙酯、己二酸二正丁酯、月桂酸己酯、丙二醇二壬酸酯、支链状的短链长脂肪酸与链长为C₁₆~C₁₈等的饱和脂肪酸的甘油酯、肉豆蔻酸异丙酯、棕榈酸异丙酯、链长为C₁₂~C₁₈等的饱和脂肪酸的辛酸酯或癩酸酯、硬脂酸异丙酯、油酸油酯、油酸癩酯、油酸乙酯、乳酸乙酯、蜡状脂肪酸酯、邻苯二甲酸二丁酯、己二酸二异丙酯等酯类、异十三烷醇、2-辛基十二烷醇、鲸蜡硬脂醇、油醇等醇类等。

[0078] 作为亲水性相的实例,可列举出水、丙二醇、丙三醇、山梨醇等。

[0079] 作为乳化剂,可列举出经聚氧乙基化的蓖麻油、经聚氧乙基化的山梨糖醇酐单油酸酯、山梨糖醇酐单硬脂酸酯、甘油单硬脂酸酯、硬脂酸聚氧乙酯、烷基酚聚乙二醇醚等非离子表面活性剂;月桂亚氨基二丙酸二钠、卵磷脂等两性表面活性剂;月桂基硫酸钠、脂肪醇醚硫酸盐、单/二烷基聚乙二醇醚正磷酸酯的单乙醇胺盐等阴离子表面活性剂;十六烷基三甲基氯化铵等阳离子表面活性剂等。

[0080] 作为消泡剂,可例示出Shin-Etsu Silicone(Shin-Etsu Chemical Co.,Ltd.制造)、DOWSIL SM 5512(Dow Corning Toray Silicone Co.,Ltd.制造)、ANTIFOAM E-20(Kao Corporation制造)、SILFOAM SE39(wacker asahikasei silicone co.,ltd.制造)等。

[0081] 作为其他辅助剂的实例,可列举出羧甲基纤维素、甲基纤维素、聚丙烯酸酯、海藻酸盐(alginate)、明胶、阿拉伯胶、聚乙烯吡咯烷酮、聚乙烯醇、甲基乙基醚、马来酸酐的共聚物、聚乙二醇、蜡、胶体二氧化硅等。

[0082] 半固体制备物可通过涂布或平敷在动物的皮肤上、又或导入至体腔中而进行给药。凝胶可通过以上文中针对注射用液体剂记载的方式制成溶液,并向该溶液中加入对产生软膏状的具有粘稠性的透明物质而言充分的增稠剂来制备。

[0083] 将本发明的外部或内部寄生虫防除剂用作属于人或除人以外的哺乳类或鸟类的动物的药物时,有效成分的最佳量(有效量)会根据治疗或预防的区别、感染寄生虫的种类、感染的类型和程度、剂型等而改变,但一般而言,在口服给药的情况下,有效成分的最佳量(有效量)为每天约0.0001至10000mg/kg体重的范围。在非口服给药的情况下,有效成分的最佳量(有效量)为每天约0.0001至10000mg/kg体重的范围,可一次性给药或分次给药。

[0084] 本发明的外部或内部寄生虫防除剂中的有效成分的浓度通常为0.001~100质量%,优选为0.001~99质量%,进一步优选为0.005~20质量%左右。本发明的内部寄生虫防除剂可以是直接给药的组合物,也可以是在使用时在稀释成适当浓度后进行使用的高浓度组合物。

[0085] 此外,为了增强或补充本发明的外部或内部寄生虫防除剂的效果,也可以同时使用现有的内部寄生虫防除剂。同时进行使用时,可以是在给药前混合两种以上的有效成分而得到的制剂,也可以将两种以上的不同的制剂分开进行给药。

[0086] 接着,对以本发明的通式(1)所表示的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类为有效成分的农业园艺用杀虫剂进行说明。由于本发明的化合物对给水田作物、旱田作物、果树、蔬菜、其他作物及花卉等造成灾害的所述害虫具有显著的防除效果,因此通过根据预测产生害虫的时期,在害虫产生前或确认到害虫产生时施用于育苗设施、水田、旱田、果树、蔬菜、其他作物、花卉等的种子、水田水、茎叶或土壤等栽培载体等,能够发挥本发明的农业园艺用杀虫剂的所期望的效果。其中,优选的使用方式为:通过施用于作物、花卉等的育苗土壤、移植时的栽植坑土壤、植株根部、灌溉水、水耕栽培中的栽培水等,从而经由土壤或不经由土壤而由根吸收本发明化合物的施用方式、即利用了内吸性的施用方式。

[0087] 可使用本发明的农业园艺用杀虫剂的有益植物没有特别限定,例如可列举出谷类(例如,水稻、大麦、小麦、黑麦、燕麦、玉米等)、豆类(大豆、红豆、蚕豆、豌豆、芸豆、落花生等)、果树·果实类(苹果、柑橘类、梨、葡萄、桃、梅、樱桃、核桃、栗子、杏仁、香蕉等)、叶·蔬果类(卷心菜、番茄、菠菜、西兰花、生菜、洋葱、葱(胡葱、冬葱等)、青椒、茄子、草莓、胡椒、秋葵、韭菜等)、根菜类(胡萝卜、马铃薯、白薯、芋头、萝卜、芜菁、藕、牛蒡、大蒜、辣韭等)、加工用作物(棉、麻、糖萝卜、啤酒花、甘蔗、甜菜、橄榄、橡胶、咖啡、烟草、茶等)、瓜类(南瓜、黄瓜、西瓜、香瓜、甜瓜等)、牧草类(鸭茅、高粱、梯牧草、三叶草、紫花苜蓿等)、草类(韩国草、翦股颖等)、香料等鉴赏用作物(薰衣草、迷迭香、百里香、欧芹、胡椒、生姜等)、花卉类(菊、蔷薇、康乃馨、兰、郁金香、百合等)、庭园树木(银杏、樱类、珊瑚木等)、林木(冷杉类、云杉类、松类、柏、杉、桧、桉等)等植物。

[0088] 上述“植物”还包括通过古典育种法或基因重组技术而被赋予了对异噁唑草酮等HPPD抑制剂、咪唑乙烟酸、噻吩磺隆等ALS抑制剂、草甘膦等EPSP合成酶抑制剂、草铵膦等谷氨酰胺合成酶抑制剂、稀禾定等乙酰辅酶A羧化酶抑制剂、溴苯腈、麦草畏、2,4-D等除草剂的耐性的植物。

[0089] 作为通过古典育种法而被赋予了耐性的“植物”的实例,有对咪唑乙烟酸等咪唑啉酮类ALS抑制型除草剂具有耐性的菜子、小麦、向日葵、水稻,其已经以Clearfield(注册商标)的商品名称进行贩售。同样地,还有通过古典育种法而对噻吩磺隆等磺酰脲类ALS抑制型除草剂具有耐性的大豆,其已经以STS大豆的商品名称进行贩售。同样地,作为通过古典育种法而被赋予了对三酮肟(Trione oxime)类、芳氧基苯氧基丙酸类除草剂等乙酰辅酶A羧化酶抑制剂的耐性的植物的实例,有SR玉米等。

此外,在Proceedings of the National Academy of Sciences of the United States of America(Proc.Natl.Acad.Sci.USA)87卷、7175~7179页(1990年)等中,记载了被赋予了对乙酰辅酶A羧化酶抑制剂的耐性的植物。此外,在杂草科学(Weed Science)53卷、728~746页(2005年)等中,报告了对乙酰辅酶A羧化酶抑制剂具有耐性的突变乙酰辅酶A羧化酶,通过使用基因重组技术将该突变乙酰辅酶A羧化酶的基因导入植物、或者通过将涉及抗性赋予的突变导入植物乙酰辅酶A羧化酶中,能够制作出对乙酰辅酶A羧化酶抑制剂具有耐性的植物,进一步,通过将以嵌合修复术(chimeroplasty technology)(Gura T.1999.Repairing the Genome's Spelling Mistakes.Science 285:316-318.)为代表的碱基取代突变导入核酸导入至植物细胞内,在植物的乙酰辅酶A羧化酶基因或ALS基因等中导入位点特异性氨基酸取代突变,能够制作出对乙酰辅酶A羧化酶抑制剂或ALS抑制剂等具

有耐性的植物,也可对这些植物使用本发明的农业园艺用杀虫剂。

[0090] 对与本发明的化合物或其盐类进行组合使用的毒素进行说明。作为在基因重组植物中表达的毒素,例如可列举出来自蜡样芽孢杆菌(*Bacillus cereus*)或蛭螬乳状菌(*Bacillus popilliae*)的杀虫性蛋白质;来自苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*)的Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C等 δ -内毒素;VIP1、VIP2、VIP3或VIP3A等杀虫蛋白质;来自线虫的杀虫蛋白质;蝎毒素、蜘蛛毒素、蜂毒素或昆虫特异性神经毒素等由动物产生的毒素;丝状菌类毒素;植物凝集素;凝集素;胰蛋白酶抑制剂、丝氨酸蛋白酶抑制剂、马铃薯块茎特异蛋白、半胱氨酸蛋白酶抑制剂、木瓜蛋白酶抑制剂等蛋白酶抑制剂;蓖麻毒蛋白、玉米-RIP、相思豆毒蛋白、丝瓜籽核糖体失活蛋白(luffin)、肥皂草毒蛋白、异株泻根毒蛋白等核糖体失活蛋白质(RIP);3-羟基类固醇氧化酶、蜕皮甾体尿苷二磷酸葡萄糖转移酶、胆固醇氧化酶等类固醇代谢酶;蜕皮激素抑制剂;HMG-CoA还原酶;钠离子通道阻滞剂、钙离子通道阻滞剂等离子通道阻滞剂;保幼激素酯酶;利尿激素受体;芪合酶;联苳合酶(bibenzyl synthase);几丁质酶;葡聚糖酶等。

[0091] 此外,作为在这样的基因重组植物中表达的毒素,还包含Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1、Cry9C、Cry34Ab或Cry35Ab等 δ -内毒素蛋白质,VIP1、VIP2、VIP3或VIP3A等杀虫蛋白质的混合毒素,缺失了一部分的毒素,经修饰的毒素。混合毒素通过使用重组技术、由这些蛋白质的不同结构域的新组合制成。作为缺失了一部分的毒素,已知有缺失了氨基酸序列的一部分的Cry1Ab。作为经修饰的毒素,其中,天然型毒素的氨基酸中的一个或多个被取代。

这些毒素的实例及可合成这些毒素的重组植物记载于EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451 878、WO 03/052073等中。

[0092] 这些重组植物所含的毒素,特别是对植物赋予对甲虫目害虫、半翅目害虫、双翅目害虫、鳞翅目害虫、线虫类的耐性。本发明的农业园艺用杀虫剂可与上述技术同时使用,或者也可进行体系化而使用。

[0093] 用于防除各种害虫时,本发明的农业园艺用杀虫剂只需以能够有效防除害虫或线虫的量,直接使用、或用水等适当稀释而使用、又或以混悬的形式使用于预测产生该害虫及线虫的植物即可,例如,对于在果树、谷类、蔬菜等中产生的害虫及线虫,除了在茎叶部进行散布以外,还可以进行将种子浸渍于药剂、种子包衣、过氧化钙处理等种子处理,进行土壤全层混合、垄沟施用、苗床土混合、穴盘苗处理、栽植坑处理、株根处理、追肥、水稻的箱处理、水面施用等,对土壤等进行处理而由根吸收从而进行使用。此外,还可以通过施用营养液(水耕)栽培的营养液中、熏烟或树干注入等而进行使用。

进一步,本发明的农业园艺用杀虫剂只需以能够有效防除害虫的量直接使用、或用水等适当稀释而使用、又或以混悬的形式使用于预测产生该害虫的场所即可,例如,除了对贮粮害虫、家屋害虫、卫生害虫、森林害虫等进行散布以外,还可以涂布于家屋建材,用作熏烟、诱饵等。

[0094] 作为种子处理的方法,例如可列举出稀释或不稀释液状或固体状的制剂,以液体状态浸渍种子而使药剂浸透的方法;将固体制剂或液状制剂与种子混合,进行包衣处理而使其附着在种子表面的方法;与树脂、聚合物等附着性载体混合而涂布在种子上的方法;在插秧的同时散布在种子附近的方法等。

进行该种子处理的“种子”是指,用于植物繁殖的栽培初期的植物体,除了种子以外,例如可列举出球根、块茎、种薯、株芽、珠芽、鳞茎或插枝栽培用的营养繁殖用的植物体。

实施本发明的使用方法时的植物的“土壤”或“栽培载体”是指用于栽培作物的支持体,特别是表示用于生根的支持体,其材质没有特别限制,只要是植物可生长的材质即可,即,可以是土壤、育苗垫、水等,作为具体的素材,例如可以是沙子、轻石、蛭石、硅藻土、琼脂、凝胶状物质、高分子物质、石棉、玻璃棉、木材屑、树皮等。

[0095] 作为对作物茎叶部或贮粮害虫、家屋害虫、卫生害虫或森林害虫等进行散布的方法,可列举出:用水适当稀释乳剂、胶悬剂等液体制剂或者用水适当稀释可湿性粉剂或可湿性颗粒剂等固体制剂并进行散布的方法;散布粉剂的方法;或熏烟等。

作为施用在土壤中的方法,例如可列举出:将液体制剂稀释于水中或不进行稀释而施用于植物体的株根或育苗用苗床等的方法;将颗粒剂散布于植物体的株根或用于育苗的苗床等的方法;在播种前或移植前散布粉剂、可湿性粉剂、可湿性颗粒剂、颗粒剂等,使其与土壤整体混合的方法;在播种前或种植植物体前,将粉剂、可湿性粉剂、可湿性颗粒剂、颗粒剂等散布于栽植坑、垄沟等的方法等。

[0096] 作为施用在水稻育苗箱中的方法,剂型有时会因例如播种时施用、绿化期施用、移植时施用等施用时期而异,但以粉剂、可湿性颗粒剂、颗粒剂等剂型进行施用即可。也可通过与培土的混合而进行施用,可以进行培土与粉剂、可湿性颗粒剂或颗粒剂等混合,例如苗床土混合、覆土混合、与培土整体的混合等。也可仅通过制成培土与各种制剂交替的层状而进行施用。

作为施用在水田中的方法,通常将大粒剂、袋剂(pack agent)、颗粒剂、可湿性颗粒剂等固体制剂,胶悬剂、乳剂等液体状制剂散布于处于灌满水状态的水田中。此外,在插秧时,可以将适当的制剂直接散布并注入于土壤中,或是也可与肥料混合后散布并注入于土壤中。此外,也可通过在出水口或灌溉装置等水田水的流入源中利用乳剂、胶悬剂等的药液,从而随着水的供给而省力地施用。

[0097] 对于旱田作物,在自播种至育苗期的过程中,可以对靠近种子或植物体的栽培载体等进行处理。对于直接播种在旱田的植物,除了直接对种子进行处理以外,优选对栽培中的植物的株根进行处理。也可使用颗粒剂进行散布处理,或将稀释或未稀释于水中的药剂以液状进行灌注处理等。将颗粒剂与播种前的栽培载体混合后再进行播种的处理也是一种优选的处理方式。

作为进行移植的栽培植物的播种、育苗期的处理,除了直接对种子进行处理以外,优选在育苗用苗床中灌注液状药剂的处理、或在育苗用苗床中散布颗粒剂的处理。此外,在定植时用颗粒剂处理栽植坑或与移植场所周边的栽培载体进行混合也是一种优选的处理方式。

本发明的农业园艺用杀虫剂通常按照农药制剂上的常规方法,制剂成便于使用的形状而进行使用。即,本发明的通式(1)所表示的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类以以下方式进行使用即可:将其溶解、分离、混悬、混合、含浸、吸附或附着于适当的惰性载体、或根据需要以适当的比例将其与辅助剂同时掺合并溶解、分离、混悬、混合、含浸、吸附或附着于适当的惰性载体,从而制剂成如混悬剂、乳剂、液体制剂、可湿性粉剂、可湿性颗粒剂、颗粒剂、粉剂、片剂、袋剂等适宜的剂型。

[0098] 除了有效成分以外,本发明的组合物(农业园艺用杀虫剂或动物寄生生物防除剂)可根据需要含有通常用于农药制剂或动物寄生生物防除剂中的添加成分。作为该添加成分,可列举出固体载体、液体载体等载体,表面活性剂、分散剂(dispersant)、湿润剂、结合剂、增黏剂、增稠剂、着色剂、扩展剂、分散剂(spreader)、防冻剂、抗凝剂、崩解剂、防分解剂等。此外,根据需要,也可将防腐剂、植物片等用于添加成分。这些添加成分可单独使用,或者也可组合使用两种以上。

[0099] 作为固体载体,例如可列举出石英、黏土、高岭土、叶蜡石、绢云母、滑石粉、膨润土、酸性白土、绿坡缕石、沸石、硅藻土等天然矿物类,碳酸钙、硫酸铵、硫酸钠、氯化钾等无机盐类,合成硅酸、合成硅酸盐、淀粉、纤维素、植物粉末(例如锯末、椰壳、玉米穗杆、烟叶茎等)等有机固体载体,聚乙烯、聚丙烯、聚偏二氯乙烯等塑料载体,尿素、无机中空体、塑料中空体、气相二氧化硅(fumed silica,白碳)等。这些固体载体可单独使用,或者也可组合使用两种以上。

[0100] 作为液体载体,例如可列举出如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇等一元醇类,乙二醇、二乙二醇、丙二醇、己二醇、聚乙二醇、聚丙二醇、丙三醇等多元醇类这样的醇类,丙二醇醚等多元醇化合物类,丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮、二异丁酮、环己酮等酮类,乙醚、二噁烷、乙二醇单乙醚、二丙醚、四氢呋喃等醚类,正链烷烃、环烷、异链烷烃、煤油、矿油等脂肪族烃类,苯、甲苯、二甲苯、溶剂石脑油、烷基萘等芳香族烃类,二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等卤代脂肪族烃类,乙酸乙酯、邻苯二甲酸二异丙酯、邻苯二甲酸二丁酯、邻苯二甲酸二辛酯、己二酸二甲基酯等酯类, γ -丁内酯等内酯类,二甲基甲酰胺、二乙基甲酰胺、二甲基乙酰胺、N-烷基吡咯烷酮等酰胺类,乙腈等腈类,二甲基亚砷等硫化物类,大豆油、菜籽油、绵籽油、蓖麻油等植物油,水等。这些液体载体可单独使用,或者也可组合使用两种以上。

[0101] 作为用作分散剂、湿展剂的表面活性剂,例如可列举出山梨糖醇酐脂肪酸酯、聚氧乙烯山梨糖醇酐脂肪酸酯、蔗糖脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯树脂酸酯、聚氧乙烯脂肪酸二酯、聚氧乙烯烷基醚、聚氧乙烯烷基芳基醚、聚氧乙烯烷基苯基醚、聚氧乙烯二烷基苯基醚、聚氧乙烯烷基苯基醚福尔马林缩合物、聚氧乙烯聚氧丙烯嵌段共聚物、聚苯乙炔聚氧乙烯嵌段聚合物、烷基聚氧乙烯聚丙烯嵌段共聚物醚、聚氧乙烯烷基胺、聚氧乙烯脂肪酸酰胺、聚氧乙烯脂肪酸二苯基醚、聚亚烷基苄基苯基醚、聚氧化烯苯乙炔基苯基醚、乙炔二醇、聚氧化烯加成乙炔二醇、聚氧乙烯醚型有机硅、酯型有机硅、氟类表面活性剂、聚氧乙烯蓖麻油、聚氧乙烯氢化蓖麻油等非离子表面活性剂,烷基硫酸盐、聚氧乙烯烷基醚硫酸盐、聚氧乙烯烷基苯基醚硫酸盐、聚氧乙烯苯乙炔基苯基醚硫酸盐、烷基苯磺酸盐、烷基芳基磺酸盐、木质素磺酸盐、烷基磺基琥珀酸盐、萘磺酸盐、烷基萘磺酸盐、萘磺酸的福尔马林缩合物的盐、烷基萘磺酸的福尔马林缩合物的盐、脂肪酸盐、聚羧酸盐、聚丙烯酸盐、N-甲基-脂肪酸肌氨酸盐、树脂酸盐、聚氧乙烯烷基醚磷酸盐、聚氧乙烯烷基苯基醚磷酸盐等阴离子表面活性剂,月桂胺盐酸盐、硬脂胺盐酸盐、油胺盐酸盐、硬脂胺乙酸盐、硬脂氨基丙胺乙酸盐、氯化烷基三甲基铵、烷基二甲基苯扎氯铵(alkyldimethyl benzalkonium chloride)等烷基胺盐等阳离子表面活性剂,氨基酸型或甜菜碱型等两性表面活性剂等。这些表面活性剂可单独使用,或者也可组合使用两种以上。

[0102] 作为结合剂、增黏剂,例如可列举出羧甲基纤维素或其盐、糊精、水溶性淀粉、黄原胶、瓜尔胶、蔗糖、聚乙烯吡咯烷酮、阿拉伯树胶、聚乙烯醇、聚乙烯乙酸酯、聚丙烯酸钠、平

均分子量为6000~20000的聚乙二醇、平均分子量为10万~500万的聚环氧乙烷、磷脂质(例如,脑磷脂、卵磷脂等)、纤维素粉末、糊精、加工淀粉、聚氨基酸螯合化合物、交联聚乙烯吡咯烷酮、马来酸与苯乙烯类的共聚物、(甲基)丙烯酸类共聚物、由多元醇形成的聚合物与二羧酸酐的半酯、聚苯乙烯磺酸的水溶性盐、石蜡、萘、聚酰胺树脂、聚丙烯酸盐、聚氧乙烯、蜡、聚乙烯基烷基醚、烷基酚福尔马林缩合物、合成树脂乳液等。

[0103] 作为增稠剂,例如可列举出如黄原胶、瓜尔胶、定优胶(diutan gum)、羧甲基纤维素、聚乙烯吡咯烷酮、羧基乙烯基聚合物、丙烯酸类聚合物、淀粉化合物、多糖类这样的水溶性高分子,如高纯度膨润土、气相二氧化硅(fumed silica,白碳)这样的无机微粉等。

[0104] 作为着色剂,例如可列举出如氧化铁、氧化钛、普鲁士蓝这样的无机颜料,如茜素染料、偶氮染料、金属酞菁染料这样的有机染料等。

[0105] 作为防冻剂,例如可列举出乙二醇、二乙二醇、丙二醇、丙三醇等多元醇类等。

[0106] 作为用于抗凝、促进崩解的辅助剂,例如可列举出淀粉、海藻酸、甘露糖、半乳糖等多糖类,聚乙烯吡咯烷酮、气相二氧化硅(fumed silica,白碳)、酯胶(ester gum)、石油树脂、三聚磷酸钠、六偏磷酸钠、硬脂酸金属盐、纤维素粉末、糊精、甲基丙烯酸酯的共聚物、聚乙烯吡咯烷酮、聚氨基酸螯合化合物、磺化苯乙烯-异丁烯-马来酸酐共聚物、淀粉-聚丙烯腈接枝共聚物等。

[0107] 作为防分解剂,例如可列举出如沸石、生石灰、氧化镁这样的干燥剂,酚类化合物、胺化合物、硫化物、磷酸化合物等抗氧化剂,水杨酸化合物、二苯甲酮化合物等紫外线吸收剂等。

[0108] 作为防腐剂,例如可列举出山梨酸钾、1,2-苯并噻唑啉-3-酮等。

进一步,还可以根据需要使用功能性分散剂、增效醚等代谢分解抑制剂等的活性增强剂、丙二醇等防冻剂、BHT等抗氧化剂、紫外线吸收剂等其他的辅助剂。

[0109] 有效成分化合物的掺合比例可根据需要进行增减,在100重量份的本发明的农业园艺用杀虫剂中,在0.01~90重量份的范围内适当选择、使用即可,例如在制成粉剂、颗粒剂、乳剂或可湿性粉剂时,0.01~50重量份(相对于农业园艺用杀虫剂整体的重量为0.01~50重量%)较为适宜。

[0110] 本发明的农业园艺用杀虫剂的用量会因各种因素,例如目的、对象害虫、作物的生长状况、害虫的产生倾向、气候、环境条件、剂型、施用方法、施用场所、施用时期等而发生变动,根据目的,在以有效成分化合物计、每10公顷0.001g~10kg的范围内适当选择本发明的农业园艺用杀虫剂的用量即可,优选在每10公顷0.01g~1kg的范围内进行选择。

为了扩大防除的对象病虫害、防除的适宜时期,或者以谋求降低药量为目的,本发明的农业园艺用杀虫剂也可与其他农业园艺用杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀菌剂、生物农药等混合使用,此外,也可根据使用场所,与除草剂、植物生长调节剂、肥料等混合使用。

[0111] 作为以上述目的进行使用的其他农业园艺杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂,例如可例示出3,5-二甲苯基甲基氨基甲酸酯(XMC)、苏云金杆菌鲎泽变种(*Bacillus thuringiensis aizawai*)、苏云金杆菌以色列亚种(*Bacillus thuringiensis israelensis*)、苏云金杆菌日本亚种(*Bacillus thuringiensis japonensis*)、苏云金杆菌库斯塔变种(*Bacillus thuringiensis kurstaki*)、苏云金杆菌粉甲变种(*Bacillus thuringiensis tenebrionis*)、苏云金杆菌(*Bacillus thuringiensis*)生成的结晶蛋白质毒素、BPMC、Bt毒

素类杀虫性化合物、CPCBS (杀螨酯, chlorfenson)、DCIP (二氯异乙醚, dichlorodiisopropyl ether)、D-D (1,3-二氯丙烯, 1,3-Dichloropropene)、DDT、NAC、0-4-二甲基氨基磺酰基苯基0,0-二乙基硫代磷酸酯 (0-4-dimethylsulfamoylphenyl 0,0-diethylphosphorothioate, DSP)、0-乙基0-4-硝基苯基苯基硫代磷酸酯 (0-ethyl 0-4-nitrophenyl phenylphosphonothioate, EPN)、三丙基异氰脲酸酯 (TPIC)、氟丙菊酯 (acrinathrin)、印楝素 (azadirachtin)、保棉磷 (azinphos-methyl)、灭螨醌 (acequinocyl)、啉虫脒 (acetamidiprid)、乙酰虫脒 (acetoprole)、乙酰甲胺磷 (acephate)、阿巴美丁 (abamectin)、除虫菌素-B (avermectin-B)、磺胺螨酯 (amidoflumet)、双甲脒 (amitraz)、棉铃威 (alanycarb)、涕灭威 (aldicarb)、涕灭砒威 (aldoxycarb)、艾氏剂 (aldrin)、 α -硫丹 (alpha-endosulfan)、 α -氯氰菊酯 (alpha-cypermethrin)、阿苯达唑 (albendazole)、丙烯菊酯 (allethrin)、氯唑磷 (isazofos)、艾沙米多福 (isamidofos)、isoamidofos、加福松 (isoxathion)、异柳磷 (isofenphos)、异丙威 (isoprocarb:MIPC)、伊维菌素 (ivermectin)、新烟碱类杀线虫剂 (imicyafos)、吡虫啉 (imidacloprid)、炔咪菊酯 (imiprothrin)、茚虫威 (indoxacarb)、高氰戊菊酯 (esfenvalerate)、乙硫苯威 (ethiofencarb)、乙硫磷 (ethion)、乙虫脒 (ethiprole)、乙螨唑 (etoxazole)、醚菊酯 (ethofenprox)、丙线磷 (ethoprophos)、乙嘧硫磷 (etrimfos)、埃玛菌素 (emamectin)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐 (emamectin-benzoate)、硫丹 (endosulfan)、烯炔菊酯 (empenthrin)、杀线威 (oxamyl)、砒吸磷 (oxydemeton-methyl)、异亚砒磷 (oxydeprofos:ESP)、奥苯达唑 (oxibendazole)、奥吩达唑 (oxfendazole)、油酸钾 (Potassium oleate)、油酸钠 (sodium oleate)、硫线磷 (cadusafos)、巴丹 (cartap)、西维因 (carbaryl)、丁硫克百威 (carbosulfan)、克百威 (carbofuran)、 γ -氯氟氰菊酯 (gamma-cyhalothrin)、灭杀威 (xylylcarb)、喹硫磷 (quinalphos)、烯虫炔酯 (kinoprene)、灭螨猛 (chinomethionat)、地虫威 (cloethocarb)、噻虫胺 (clothianidin)、四螨嗪 (clofentezine)、环虫酰肼 (chromafenozide)、氯虫苯甲酰胺 (chlorantraniliprole)、氯氧磷 (chlorethoxyfos)、杀虫脒 (chlordimeform)、氯丹 (chlordan)、毒死蜱 (chlorpyrifos)、甲基毒死蜱 (chlorpyrifos-methyl)、溴虫脒 (chlorphenapyr)、杀螨酯 (chlorfenson)、毒虫畏 (chlorfenvinphos)、定虫隆 (chlorfluazuron)、乙酯杀螨醇 (chlorobenzilate)、氯代苯甲酸 (chlorobenzoate)、开乐散 (三氯杀螨醇:dicofol)、杀力松 (salithion)、杀螟脒 (cyanophos:CYAP)、丁醚脒 (diafenthiuron)、除线特 (diamidafos)、溴氰虫酰胺 (cyantraniliprole)、 θ -氯氰菊酯 (theta-cypermethrin)、除螨灵 (dienochlor)、腈吡螨酯 (cyenopyrafen)、蔬果磷 (dioxabenzofos)、苯虫醚 (diofenolan)、 σ -氯氰菊酯 (sigma-cypermethrin)、除线磷 (dichlofenthion:ECP)、乙氰菊酯 (cycloprothrin)、敌敌畏 (dichlorvos:DDVP)、乙拌磷 (disulfoton)、呋虫胺 (dinotefuran)、氯氟氰菊酯 (cyhalothrin)、苯醚氰菊酯 (cyphenothrin)、氟氯氰菊酯 (cyfluthrin)、除虫脒 (diflubenzuron)、丁氟螨酯 (cyflumetofen)、氟螨嗪 (diflovidazin)、三环锡 (cyhexatin)、氯氰菊酯 (cypermethrin)、甲基毒虫畏 (dimethylvinphos)、乐果 (dimethoate)、四氟甲醚菊酯 (dimefluthrin)、氟硅菊酯 (silaflluofen)、灭蝇胺 (cyromazine)、乙基多杀菌素 (spinetoram)、多杀菌素 (spinosad)、螺螨酯 (spirodiclofen)、螺虫乙酯 (spirotetramat)、螺甲螨酯 (spiromesifen)、氟虫胺

(sulfluramid)、硫丙磷(sulprofos)、氟啉虫胺腈(sulfoxaflo)、 ζ -氯氰菊酯(zeta-cypermethrin)、二嗪农(diazinon)、氟胺氰菊酯(tau-fluvalinate)、棉隆(dazomet)、噻虫啉(thiacloprid)、噻虫嗪(thiamethoxam)、硫双灭多威(thiodicarb)、杀虫环(thiocyclam)、thiosultap、杀虫双(thiosultap-sodium)、硫磷嗪(thionazin)、甲基乙拌磷(thiometon)、避蚊胺(deet)、狄氏剂(dieldrin)、杀虫畏(tetrachlorvinphos)、三氯杀螨砜(tetradifon)、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)、胺菊酯(tetramethrin)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、虫酰肼(tebufenozide)、吡螨胺(tebufenpyrad)、七氟菊酯(tefluthrin)、伏虫隆(teflubenzuron)、异吸硫磷(demeton-S-methyl)、双硫磷(temephos)、溴氰菊酯(deltamethrin)、特丁磷(terbufos)、溴代吡咯腈(tralopyril)、四溴菊酯(tralomethrin)、四氟苯菊酯(transfluthrin)、啉蚜威(triazamate)、啉呀威(triazuron)、水杨菌胺(trichlamide)、敌百虫(trichlorphon:DEP)、杀虫隆(triflumuron)、啉虫酰胺(tolfenpyrad)、二溴磷(naled:BRP)、硝虫噻嗪(nithiazine)、烯啉虫胺(nitenpyram)、双苯氟脲(novaluron)、多氟脲(noviflumuron)、烯虫乙酯(hydroprene)、氟吡啉虫(vaniliprole)、蚜灭多(vamidothion)、对硫磷(parathion)、甲基对硫磷(parathion-methyl)、苜蓿醚(halfenprox)、氯虫酰肼(halofenozide)、双三氟虫脲(bistrifluron)、杀虫双(bisultap)、氟蚁腠(hydramethylnon)、羟丙基淀粉(hydroxypropyl starch)、乐杀螨(binapacryl)、联苯腈酯(bifenazate)、氟氯菊酯(bifenthrin)、吡蚜酮(pymetrozine)、吡啉硫磷(pyraclorfos)、啉啉威(pyrafluprole)、啉啉硫磷(pyridafenthion)、啉啉酮(pyridaben)、啉虫丙醚(pyridalyl)、吡氟啉虫啉(pyrifluquinazon)、吡啉虫啉(pyriprole)、蚊蝇醚(pyriproxyfen)、抗蚜威(pirimicarb)、啉啉醚(pyrimidifen)、甲基嘧啶磷(pirimiphos-methyl)、除虫菊酯(pyrethrins)、氟虫腈(fipronil)、啉啉醚(fenazaquin)、苯线磷(fenamiphos)、溴螨酯(bromopropylate)、杀螟硫磷(fenitrothion:MEP)、苯氧威(fenoxycarb)、苯硫威(fenothiocarb)、苯醚菊酯(phenothrin)、仲丁威(fenobucarb)、丰索磷(fensulfothion)、倍硫磷(fenthion:MPP)、稻丰散(phenthoate:PAP)、氟戊菊酯(fenvalerate)、啉啉酯(fenpyroximate)、甲氰菊酯(fenpropathrin)、芬苯达啉(fenbendazole)、噻啉磷(fosthiazate)、伐虫脒(formetanate)、特啉硫磷(butathiofos)、噻啉酮(buprofezin)、呋线威(furathiocarb)、炔丙菊酯(prallethrin)、啉啉酯(flucacrypyrim)、氟啉胺(fluzinam)、氟啉啉脲(fluzuron)、氟噻虫砜(flusulfone)、氟啉脲(flucycloxuron)、氟戊菊酯(flucythrinate)、氟胺氰菊酯(flualinate)、吡氟硫磷(flupyrazofos)、啉啉胺(flufenerim)、氟虫脲(flufenoxuron)、氟啉嗪(flufenzine)、三氟醚菊酯(flufenprox)、苜蓿醚(fluproxyfen)、溴氟菊酯(flubrocycythrinate)、氟虫双酰胺(flubendiamide)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、flurimfen、丙硫磷(prothiofos)、protrifenbute、氟啉虫酰胺(flonicamid)、丙虫磷(propaphos)、炔螨特(propargite:BPPS)、丙溴磷(profenofos)、丙氟菊酯(profluthrin)、残杀威(propoxur:PHC)、溴螨酯(bromopropylate)、 β -氟氯氰菊酯(beta-cyfluthrin)、氟铃脲(hexaflumuron)、噻啉酮(hexythiazox)、庚烯磷(heptenophos)、氯菊酯(permethrin)、异噻虫啉(benclothiaz)、恶虫威(bendiocarb)、杀虫磺(bensultap)、苯螨特(benzoximate)、丙硫克百威(benfuracarb)、辛硫磷(phoxim)、伏杀磷(phosalone)、噻啉磷(fosthiazate)、丁环硫磷

(fosthietan)、磷胺(phosphamidon)、磷虫威(phosphocarb)、亚胺硫磷(phosmet:PMP)、多萜菌素(polynactins)、伐虫脒(formetanate)、安果(formothion)、甲拌磷(phorate)、机油(machine oil)、马拉硫磷(malathion)、密比霉素(milbemycin)、密比霉素A(milbemycin-A)、密灭汀(milbemectin)、灭蚜磷(mecarbam)、倍硫磷亚砷(mesulfenfos)、灭多虫(methomyl)、蜗牛敌(metaldehyde)、氰氟虫腙(metaflumizone)、甲胺磷(methamidophos)、安百亩(metam-ammonium)、威百亩(metam-sodium)、灭虫威(methiocarb)、杀扑磷(methidathion:DMTP)、异硫氰酸甲酯(methylisothiocyanate)、甲基新癸酰胺(methylneodecanamide)、甲基对硫磷(methylparathion)、噁虫酮(metoxadiazone)、甲氧滴滴涕(methoxychlor)、甲氧虫酰肼(methoxyfenozide)、甲氧苄氟菊酯(metofluthrin)、烯虫酯(methoprene)、速灭威(metolcarb)、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、速灭磷(mevinphos)、久效磷(monocrotophos)、杀虫单(monosultap)、 λ -氯氟氰菊酯(lambda-cyhalothrin)、利阿诺定(ryanodine)、虱螨脲(lufenuron)、苜呋菊酯(resmethrin)、雷皮菌素(lepimectin)、鱼藤酮(rotenone)、盐酸左旋咪唑(levamisol hydrochloride)、苯丁锡(fenbutatin oxide)、酒石酸甲噻吩啉(morantel tartarate)、溴化甲烷(methyl bromide)、三环己基氢氧化锡(cyhexatin)、氰氨化钙(calcium cyanamide)、多硫化钙(calcium polysulfide)、硫磺(sulfur)及硫酸烟碱(nicotine-sulfate)等。

[0112] 作为以相同目的进行使用的农业园艺用杀菌剂,例如可例示出金色制霉素(aureofungin)、阿扎康唑(azaconazole)、氧化福美双杀菌剂(azithiram)、acypetacs、活化酯(acibenzolar)、苯并噻二唑(acibenzolar-S-methyl)、啞菌酯(azoxystrobin)、敌菌灵(anilazine)、吡啶磺菌胺(amisulbrom)、1-氨基丙基磷酸(ampropylfos)、啞啞菌胺(ametoctradin)、烯丙醇(allyl alcohol)、杀螟丹(aldimorph)、代森铵(amobam)、异噻菌胺(isotianil)、异酰菌酮(isovalledione)、萘吡菌胺(isopyrazam)、稻瘟灵(isoprothiolane)、种菌唑(ipconazole)、异菌脲(iprodione)、异丙菌胺(iprovalicarb)、异稻瘟净(iprobenfos)、抑霉唑(imazalil)、双胍辛胺(iminoctadine)、双胍辛胺-烷苯磺酸盐(iminoctadine-albesilate)、双胍辛胺-三乙酸盐(iminoctadine-triacetate)、酰菌唑(imibenconazole)、烯效唑(uniconazole)、烯效唑-P(uniconazole-P)、氯唑灵(echlomezole)、克瘟散(edifenphos)、乙环唑(etaconazole)、噻唑菌胺(ethaboxam)、乙菌定(ethirimol)、伊特姆(etem)、乙氧喹(ethoxyquin)、土菌灵(etridiazole)、烯肟菌酯(enestroburin)、氟环唑(epoxiconazole)、噁霜灵(oxadixyl)、氧化萎锈灵(oxycarboxin)、8-羟基喹啉铜(copper-8-quinolinolate)、土霉素(oxytetracycline)、喹啉铜(copper-oxinate)、噁咪唑(oxpoconazole)、噁咪唑富马酸盐(oxpoconazole-fumarate)、噁唑酸(oxolinic acid)、辛噻酮(octhilinone)、呋酰胺(ofurace)、肟醚菌胺(orysastrobin)、威百亩(metam-sodium)、春雷霉素(kasugamycin)、吗菌威(carbamorph)、环丙酰菌胺(carpropamid)、多菌灵(carbendazim)、萎锈灵(carboxin)、香芹酮(carvone)、醌菌脒(quinazamid)、羟基喹啉基乙酮(quinacetol)、喹氧灵(quinoxyfen)、灭螨猛(quinomethionate)、敌菌丹(captafol)、克菌丹(captan)、精苯霜灵(kiralaxyl)、氯苯唑啉(quinconazole)、五氯硝基苯(quintozene)、双胍盐(guazatine)、硫杂灵(cufraneb)、福美铜氯(cuprobam)、果绿定(glyodin)、灰黄霉素(griseofulvin)、甘宝素(climbazole)、甲酚(cresol)、醚菌酯(kresoxim-methyl)、乙菌利(chlozolate)、克霉唑(clotrimazole)、

灭瘟唑(chlobenthiazone)、双胺灵(chloraniformethan)、四氯对醌(chloranil)、四氯喹噁啉(chlorquinox)、氯化苦(chloropicrin)、苯咪唑菌(chlorfenazole)、氯二硝基萘(chlorodinitronaphthalene)、百菌清(chlorothalonil)、地茂散(chloroneb)、氰菌胺(zarilamid)、水杨酰苯胺(salicylanilide)、氰霜唑(cyazofamid)、焦碳酸二乙酯(diethyl pyrocarbonate)、乙霉威(diethofencarb)、环菌胺(cyclafuramid)、双氯氰菌胺(diclocymet)、菌核利(dichlozoline)、苜氯三唑醇(diclobutrazol)、抑菌灵(dichlofluanid)、放线菌酮(cycloheximide)、哒菌清(diclomezine)、氯硝胺(dicloran)、双氯酚(dichlorophen)、二氯萘醌(dichlone)、双硫仑(disulfiram)、灭菌磷(ditalimfos)、二噻农(dithianon)、烯唑醇(diniconazole)、烯唑醇-M(diniconazole-M)、代森锌(zineb)、敌螨普(dinocap)、邻敌螨消(dinocton)、硝辛酯(dinosulfon)、硝丁酯(dinoterbon)、敌螨通(dinobuton)、硝戊酯(dinopenton)、双硫氧吡啶(dipyriithione)、二苯胺(diphenylamine)、苯醚甲环唑(difenoconazole)、环氟菌胺(cyflufenamid)、二氟林(diflumetorim)、环唑醇(cyproconazole)、噻菌环胺(cyprodinil)、酯菌胺(cyprofuram)、氰菌灵(cypendazole)、硅氟唑(simeconazole)、甲菌定(dimethirimol)、烯酰吗啉(dimethomorph)、霜脲氰(cymoxanil)、醚菌胺(dimoxystrobin)、甲基溴(methyl bromide)、福美锌(ziram)、硅噻菌胺(silthiofam)、链霉素(streptomycin)、螺环菌胺(spiroxamine)、戊苯砜(sultropen)、环苯吡菌胺(sedaxane)、苯酰菌胺(zoxamide)、棉隆(dazomet)、代森环(thiadiazin)、噻酰菌胺(tiadinil)、噻二唑(thiadifluor)、噻菌灵(thiabendazole)、硫氰苯甲酰胺(tioxymid)、硫氯苯亚胺(thiochlorfenphim)、硫菌灵(thiophanate)、甲基硫菌灵(thiophanate-methyl)、噻菌腈(thicyofen)、克杀螨(thioquinox)、灭螨猛(chinomethionat)、噻呋酰胺(thifluzamide)、福美双(thiram)、癸磷锡(decafentin)、四氧硝基苯(tecnazene)、叶枯酞(tecloftalam)、福代硫(tecoram)、氟醚唑(tetraconazole)、咪菌威(debacarb)、脱氢乙酸(dehydroacetic acid)、戊唑醇(tebuconazole)、异丁乙氧喹啉(tebufloquin)、多地辛(dodicin)、多果定(dodine)、十二烷基苯磺酸双乙二胺铜络盐(II)(DBEDC)、吗菌灵(dodemorph)、敌菌酮(drazoxolon)、三唑醇(triadimenol)、三唑酮(triadimefon)、丁三唑(triazbutil)、唑菌嗪(triazoxide)、威菌磷(triamiphos)、噻菌醇(triarimol)、水杨菌胺(trichlamide)、三环唑(tricyclazole)、灭菌唑(triticonazole)、十三吗啉(tridemorph)、三丁基氧化锡(tributyltin oxide)、氟菌唑(triflumizole)、肟菌酯(trifloxystrobin)、噻氨灵(triforine)、对甲抑菌灵(tolyfluanid)、甲基立枯磷(tolclofos-methyl)、游霉素(natamycin)、代森钠(nabam)、酞菌酯(nitrothal-isopropyl)、硝基苯乙烯(nitrostyrene)、氟苯嘧啶醇(nuarimol)、壬基酚磺酸铜(copper nonylphenol sulfonate)、丙烯酸喹啉酯(halacrinatate)、有效霉素(validamycin)、缬菌胺(valifenalate)、超敏蛋白(harpin protein)、联苯吡菌胺(bixafen)、啉氧菌酯(picoxystrobin)、氟吡菌胺(picobenzamide)、硫双二氯酚(bithionol)、双苯三唑醇(bitertanol)、土菌消(hydroxyisoxazole)、羟基异噁唑钾(hydroisoxazole-potassium)、乐杀螨(binapacryl)、联苯(biphenyl)、粉病灵(piperalin)、恶霉灵(hymexazol)、唑菌酯(pyraoxystrobin)、比锈灵(pyracarbolid)、吡唑醚菌酯(pyraclostrobin)、定菌磷(pyrazophos)、唑胺菌酯(pyrametostrobin)、甲氧苯啉菌(pyriofenone)、啉菌腈

(pyridinitril)、啉斑肟(pyrifenoxy)、吡菌苯威(pyribencarb)、嘧霉胺(pyrimethanil)、甲氧氯吡啶(pyroxychlor)、氯吡呋醚(pyroxyfur)、咯嗉酮(pyroquilon)、乙烯菌核利(vinclozolin)、噁唑菌酮(famoxadone)、咪菌腈(fenapanil)、咪唑菌酮(fenamidon)、敌磺钠(fenaminosulf)、氯苯嘧啶醇(fenarimol)、种衣酯(fenitropan)、稻瘟酰胺(fenoxanil)、嘧菌腈(ferimzone)、福美铁(ferbam)、三苯锡(fentin)、拌种咯(fenpiclonil)、胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)、腈苯唑(fenbuconazole)、甲呋酰胺(fenfuram)、苯锈啶(fenpropidin)、丁苯吗啉(fenpropimorph)、环酰菌胺(fenhexamid)、苯酞(phthalide)、丁硫啶(buthiobate)、丁胺(butylamine)、磺酸丁嘧啶(bupirimate)、麦穗宁(fuberidazole)、杀稻瘟菌素-S(blasticidin-S)、呋吡菌胺(furametpyr)、呋霜灵(furalaxyl)、嘧螨酯(flucrypyrim)、氟啶胺(fluzinam)、氟嘧菌酯(fluxastrobin)、氟苯三唑(flutrimazole)、氟吡菌胺(flupicolide)、氟吡菌酰胺(flupyram)、氟酰亚胺(fluoroimide)、二甲呋酰胺(furcarbanil)、氟唑菌酰胺(fluxapyroxad)、氟嗉唑(fludioxonil)、呋菌唑(furconazole)、呋醚唑(furconazole-cis)、咯菌腈(fludioxonil)、氟硅唑(flusilazole)、磺菌胺(flusulfamide)、噻唑烷类杀菌剂(flutianil)、氟酰胺(flutolanil)、粉唑醇(flutriafol)、糠醛(furfural)、拌种胺(furmecyclozox)、氟联苯菌(flumetover)、氟吗啉(flumorph)、丙氧嗉啉(proquinazid)、咪鲜胺(prochloraz)、腐霉利(procymidone)、胺丙威(prothiocarb)、丙硫菌唑(prothioconazole)、霜霉威(propamocarb)、丙环唑(propiconazole)、甲基代森锌(propineb)、呋菌隆(furophanate)、噻菌灵(probenazole)、糠菌唑(bromuconazole)、六氯丁二烯(hexachlorobutadiene)、己唑醇(hexaconazole)、环己硫磷(hexylthiofos)、3-苯并[b]噻吩-2-基-5,6-二氢-1,4,2-噁嗪啉4-氧化物(bethoxazin)、苯霜灵(benalaxyl)、苯霜灵M(benalaxyl-M)、麦锈灵(benodanil)、苯菌灵(benomyl)、稻瘟酯(pefurazoate)、敌菌腈(benquinox)、戊菌唑(penconazole)、抑菌啉(benzamorf)、戊菌隆(pencycuron)、苯甲羟肟酸(benzohydroxamic acid)、丙唑草隆(bentaluron)、苯噻硫氰(benthiazole)、苯噻菌胺(benthiavalicarb-isopropyl)、吡噻菌胺(penthiopyrad)、戊苯吡菌胺(penflufen)、啉酰菌胺(boscalid)、氯瘟磷(phosdiphen)、三乙膦酸(fosetyl)、三乙膦酸铝(fosetyl-Al)、多氧霉素(polyoxins)、保粒霉素(polyoxorim)、福代锌(polycarbamate)、灭菌丹(folpet)、甲醛(formaldehyde)、机油(machine oil)、代森锰(manzeb)、代森锰锌(mancozeb)、双炔酰菌胺(mandipropamid)、甲菌利(myclozolin)、腈菌唑(myclobutanil)、米多霉素(mildiomycin)、代森环(milneb)、苯并威(mecarbinzid)、磺菌威(methasulfocarb)、间氯敌菌酮(metazoxolon)、威百亩(metam)、威百亩钠(metam-sodium)、甲霜灵(metalaxyl)、精甲霜灵(metalaxyl-M)、代森联(metiram)、异硫氰酸甲酯(methyl isothiocyanate)、甲基敌螨普(mepthyldinocap)、叶菌唑(metconazole)、噻菌胺(metsulfovax)、呋菌胺(methfuroxam)、苯氧菌胺(metominostrobin)、苯菌酮(metrafenone)、嘧菌胺(mepanipyrim)、甲霜灵(mefenoxam)、消螨多(meptyldinocap)、担菌宁(mepronil)、灭锈胺(mebenil)、碘代甲烷(iodomethane)、吡咪唑(rabenzazole)、苯扎氯铵(benzalkoniumchloride)、碱性氯化铜(basic copper chloride)、碱性硫酸铜(basic copper sulfate)、金属银(silver)等无机杀菌剂、次氯酸钠(sodium hypochlorite)、氢氧化铜(cupric hydroxide)、可湿性硫粉剂(wettable sulfur)、石硫合剂(calcium

polysulfide)、碳酸氢钾(potassium hydrogen carbonate)、碳酸氢钠(sodium hydrogen carbonate)、无机硫磺(sulfur)、无水硫酸铜(copper sulfate anhydride)、二甲基二硫代氨基甲酸镍(nickel dimethyldithiocarbamate)、如8-羟基喹啉铜(oxine copper)这样的铜类化合物、硫酸锌(zinc sulfate)、五水硫酸铜(copper sulfate pentahydrate)等。

[0113] 同样地,作为除草剂,例如可例示出1-萘乙酰胺、2,4-PA、2,3,6-TBA、2,4,5-T、2,4,5-TB、2,4-D、2,4-DB、2,4-DEB、2,4-DEP、3,4-DA、3,4-DB、3,4-DP、4-CPA、4-CPB、4-CPP、MCP、MCPA、2甲4氯乙硫酯(MCPA-Thioethyl)、MCPB、碘苯腈(ioxynil)、苯草醚(aclonifen)、啞啞草酮(azafenidin)、三氟羧草醚(acifluorfen)、叠氮津(aziprotryne)、四唑嘧磺隆(azimsulfuron)、磺草灵(asulam)、乙草胺(acetochlor)、莠去津(atrazine)、莠去通(atraton)、疏草隆(anisuron)、莎稗磷(anilofos)、四烯雌酮(aviglycine)、脱落酸(abscisic acid)、胺啞草酮(amicarbazone)、啞嘧磺隆(amidosulfuron)、杀草强(amtrole)、环丙啞啞酸(aminocyclopyrachlor)、氯氨吡啞酸(aminopyralid)、特草啞酮(amibuzin)、甲基胺草磷(amiprofos-methyl)、ametridione、莠灭净(ametryn)、甲草胺(alachlor)、草毒死(allidochlor)、枯杀达(alloxydim)、五氯戊酮酸(alorac)、异噁隆(isouron)、草特灵(isocarbamid)、异噁氯草酮(isoxachlortole)、异噁草醚(isoxapyrifop)、异噁啞草酮(isoxaflutole)、异噁草胺(isoxaben)、异草定(isocil)、异草完隆(isonoruron)、异丙隆(isoproturon)、异乐灵(isopropalin)、氮草草(isopolinate)、丁啞草酮(isomethiozin)、抗倒胺(inabenfide)、抑草津(ipazine)、三啞啞草胺(ipfencarbazone)、丙草定(iprymidam)、灭草啞(imazaquin)、甲基啞草烟(imazapic)、灭草烟(imazapyr)、甲基啞草烟(imazamethapyr)、啞草酯(imazamethabenz)、啞草酸(imazamethabenz-methyl)、甲氧啞草烟(imazamox)、啞草烟(imazethapyr)、啞吡啞磺隆(imazosulfuron)、三啞茛草胺(indaziflam)、茛草酮(indanofan)、吡啞丁酸(indolebutyric acid)、烯效啞-P(uniconazole-P)、甘草津(eglinazine)、禾草畏(esprocarb)、胺苯磺隆(ethametsulfuron)、甲基胺苯磺隆(ethametsulfuron-methyl)、丁氟消草(ethalfluralin)、抑草威(ethiolate)、吡啞熟酯(ethychlozate ethyl)、磺噞隆(ethidimuron)、硝草酚(etinofen)、乙烯利(ethephon)、乙氧啞磺隆(ethoxysulfuron)、氟乳醚(ethoxyfen)、乙胺草醚(etnipromid)、乙啞草磺(ethofumesate)、乙氧苯草胺(etobenzanid)、磺啞草(epronaz)、抑草蓬(erbon)、草藻灭(endothal)、啞草酮(oxadiazon)、丙炔啞草酮(oxadiargyl)、氯啞啞草(oxaziclomefone)、环丙氧磺隆(oxasulfuron)、草啞松啞杀草敏(oxapyrazon)、乙氧氟草醚(oxyfluorfen)、氨磺乐灵(oryzalin)、啞苯胺磺隆(orthosulfamuron)、坪草丹(orbencarb)、啞草胺(cafenstrole)、cambendichlor、威磺灵(carbasulam)、啞草酮(carfentrazone)、啞酮草酯(carfentrazone-ethyl)、卡灵草(karbutilate)、长杀草(carbetamide)、异噁甲草威(carboxazole)、啞禾灵(quizalofop)、精啞禾灵(quizalofop-P)、啞禾灵(quizalofop-ethyl)、二甲苯草胺(xylachlor)、灭藻醌(quinoclamine)、氯藻胺(quinonamid)、二氯啞啞酸(quinclorac)、氯甲啞啞酸(quinmerac)、苜草隆(cumyluron)、碘氯啞酯(cliodylate)、草甘膦(glyphosate)、草铵膦(glufosinate)、草铵膦-P(glufosinate-P)、啞草敏(credazine)、烯草酮(clethodim)、坐果酸(cloxyfonac)、游离炔草酸(clodinafop)、炔草酯(clodinafop-propargyl)、绿麦隆(chlorotoluron)、二氯吡啞酸(clopyralid)、

cloproxydim、调果酸(cloprop)、氯溴隆(chlorbromuron)、氯丁草(clofop)、异噁草酮(clomazone)、氯硝醚(chlomethoxynil)、甲氧除草醚(chlomethoxyfen)、稗草胺(clomeprop)、炔禾灵(chlorazifop)、可乐津(chlorazine)、氯酯磺草胺酸(cloransulam)、地快尔(chloranocryl)、草灭平(chloramben)、氯酯磺草胺(chloransulam-methyl)、氯草敏(chloridazon)、氯嘧磺隆(chlorimuron)、氯嘧磺隆(chlorimuron-ethyl)、氯磺隆(chlorsulfuron)、氯酞酸(chlorthal)、草克乐(chlorthiamid)、绿麦隆(chlortoluron)、草枯醚(chlornitrofen)、伐草克(chlorfenac)、燕麦酯(chlorfenprop)、氯炔灵(chlorbufam)、氟咪杀(chlorflurazole)、整形醇(chlorflurenol)、chlorprocarb、氯苯胺灵(chlorpropham)、矮壮素(chlormequat)、乙氧苯隆(chloreturon)、羟敌草腓(chloroxynil)、枯草隆(chloroxuron)、三氯丙酸(chloropon)、苯嘧磺草胺(saflufenacil)、草净津(cyanazine)、氰草净(cyanatryn)、燕麦敌(di-allate)、敌草隆(diuron)、diethamquat、麦草畏(dicamba)、环莠隆(cycluron)、草灭特(cycloate)、噁草酮(cycloxydim)、双氯磺草胺(diclosulam)、环丙嘧磺隆(cyclosulfamuron)、2,4-滴丙酸(dichlorprop)、精2,4-滴丙酸(dichlorprop-P)、敌草腓(dichlobenil)、二氯苯氧基丙酸(diclofop)、禾草灵(diclofop-methyl)、苜胺灵(dichlormate)、氯双脲(dichloralurea)、敌草快(diquat)、咯草隆(cisanilide)、2,4-滴硫钠(disul)、环草隆(siduron)、氟硫草定(dithiopyr)、敌乐胺(dinitramine)、吡啶酮草酯(cinidon-ethyl)、戊硝酚(dinosam)、醚磺隆(cinosulfuron)、地乐酚(dinoseb)、特乐酚(dinoterb)、地乐特(dinofenate)、硝丙酚(dinoprop)、氰氟草酯(cyhalofop-butyl)、草乃敌(diphenamid)、枯莠隆(difenoxuron)、戊味禾草灵(difenopenten)、野燕枯(difenzoquat)、洒布净(cybutryne)、环丙津(cyprazine)、三环噁草胺(cyprazole)、吡氟草胺(diflufenican)、氟吡草胺(diflufenzopyr)、杀草净(dipropetryn)、环酰草胺(cypromid)、牧草快(cyperquat)、赤霉素(gibberellin)、西玛津(simazine)、敌灭生(dimexano)、克草胺(dimethachlor)、草啞酮(dimidazon)、异戊乙净(dimethametryn)、二甲吩草胺(dimethenamid)、西草净(simetryn)、西玛通(simeton)、哌草丹(dimepiperate)、噁唑隆(dimefuron)、环庚草醚(cinmethylin)、灭草灵(swep)、sulglycapin、磺草酮(sulcotrione)、草克死(sulfallate)、甲磺草胺(sulfentrazone)、磺酰磺隆(sulfosulfuron)、甲嘧磺隆(sulfometuron)、甲嘧磺隆甲酯(sulfometuron-methyl)、密草通(secbumeton)、稀禾定(sethoxydim)、另丁津(sebuthylazine)、特草定(terbacil)、香草隆(daimuron)、棉隆(dazomet)、茅草枯(dalapon)、噁氟隆(thiazafluron)、噁草啞(thiazopyr)、噁酮磺隆(thiencarbazone)、噁酮磺隆(thiencarbazone-methyl)、仲草丹(tiocarbazil)、硫胺草啞碱(tioclorim)、禾草丹(thiobencarb)、噁二唑草胺(thidiazimin)、噁苯隆(thidiazuron)、噁磺隆(thifensulfuron)、噁吩磺隆(thifensulfuron-methyl)、甜菜安(desmedipham)、敌草净(desmetryn)、四氟隆(tetrafluron)、噁吩草胺(thenylchlor)、牧草胺(tebutam)、丁唑隆(tebuthiuron)、甲氧去草净(terbumeton)、吡喃草酮(tepraloxym)、特糠酯酮(tefuryltrione)、环磺酮(tembotrione)、异丁草胺(delachlor)、特草定(terbacil)、芽根灵(terbucarb)、特丁草胺(terbuchlor)、特丁津(terbuthylazine)、去草净(terbutryn)、苯吡唑草酮(topramezone)、三甲苯草酮(tralkoxydim)、三嗪氟草胺(triaziflam)、醚苯磺隆(triasulfuron)、野麦畏(tri-

allate)、草达津(trietazine)、杀草畏(tricamba)、绿草定(triclopyr)、灭草环(tridiphane)、草达克(tritac)、三氟甲磺隆(tritosulfuron)、氟胺磺隆(triflusulfuron)、氟胺磺隆(triflusulfuron-methyl)、氟乐灵(trifluralin)、三氟啶磺隆(trifloxysulfuron)、茚草酮(tripropindan)、苯磺隆(tribenuron-methyl)、苯磺隆(tribenuron)、三氟苯氧丙酸(trifop)、三氟禾草肟(trifopsime)、三甲隆(trimeturon)、抑草生(naptalam)、萘丙胺(naproanilide)、敌草胺(napropamide)、烟嘧磺隆(nicosulfuron)、甲磺乐灵(nitralin)、除草醚(nitrofen)、三氟甲草醚(nitrofluorfen)、吡氯草胺(nipyraclofen)、草不隆(neburon)、达草灭(norflurazon)、草完隆(noruron)、燕麦灵(barban)、多效唑(paclobutrazol)、百草枯(paraquat)、对氟隆(parafluron)、卤草定(haloxydine)、氟吡禾灵(haloxifop)、高效氟吡禾灵(haloxifop-P)、氟吡甲禾灵(haloxifop-methyl)、氟硝磺酰胺(halosafen)、氯吡啶磺隆(halosulfuron)、氯吡啶磺隆(halosulfuron-methyl)、氨基吡啶酸(picloram)、氟吡草胺(picolinafen)、双环吡喃酮(bicyclopyrone)、双草醚(bispyribac)、双草醚钠(bispyribac-sodium)、比达农(pydanon)、唑啉草酯(pinoxaden)、甲羧除草醚(bifenox)、哌草磷(piperophos)、噁霉灵(hymexazol)、双唑草腈(pyraclonil)、磺酰草吡唑(pyrasulfotole)、苜草唑(pyrazoxyfen)、吡啶磺隆(pyrazosulfuron)、吡啶磺隆(pyrazosulfuron-ethyl)、吡唑特(pyrazolate)、双丙氨酰膦(bilanafos)、吡草醚(pyraflufen-ethyl)、氯草定(pyriclor)、啞草特(pyridafol)、2-氯-6-(4,6-二甲氧嘧啶-2-硫基)苯甲酸(pyrithiobac)、噻硫草醚(pyrithiobac-sodium)、达草特(pyridate)、环酯草醚(pyriftalid)、稗草丹(pyributicarb)、嘧啶肟草醚(pyribenzoxim)、吡丙醚(pyrimisulfan)、氟嘧磺隆(primisulfuron)、嘧草醚(pyriminobac-methyl)、砒吡草唑(pyroxasulfone)、甲氧磺草胺(pyroxsulam)、酰苯磺威(fenasulam)、棉胺宁(phenisopham)、非草隆(fenuron)、异噁苯砒(fenoxasulfone)、噁唑禾草灵(fenoxaprop)、精噁唑禾草灵(fenoxaprop-P)、噁唑禾草灵(fenoxaprop-ethyl)、酚硫杀(phenothiol)、2,4,5-涕丙酸(fenoprop)、稀草隆(phenobenzuron)、噁唑禾草灵(fenthiaprop)、氯苯氧乙醇(fenteracol)、四唑酰草胺(fentrazamide)、甜菜宁(phenmedipham)、乙基甜菜宁(phenmedipham-ethyl)、丁草胺(butachlor)、氟丙嘧草酯(butafenacil)、抑草膦(butamifos)、丁噁隆(buthiuron)、特咪唑草(buthidazole)、苏达灭(butylate)、炔草隆(buturon)、丁烯草胺(butenachlor)、丁苯草酮(butroxydim)、地乐胺(butralin)、啶嘧磺隆(flazasulfuron)、麦草氟酯(flamprop)、氟呋草醚(furyloxyfen)、广草胺(prynachlor)、氟嘧磺隆(primisulfuron-methyl)、吡氟禾草灵(fluzafop)、精吡氟禾草灵(fluzafop-P)、吡氟禾草灵(fluzafop-butyl)、异丙吡草酯(fluzalate)、氟草烟(fluroxypyr)、氟硫隆(flurothiuron)、伏草隆(flumeturon)、乙羧氟草醚(fluroglycofen)、氟咯草酮(flurochloridone)、三氟硝草醚(flurodifen)、氟化除草醚(fluronitrofen)、唑啉草(fluromidine)、氟酮磺隆(flucarbazone)、氟酮磺隆钠(flucarbazone-sodium)、氟消草(fluchloralin)、氟吡磺隆(flucetosulfuron)、噻草酸(fluthiacet)、噻草酸甲酯(fluthiacet-methyl)、氟啶嘧磺隆(flupyrsulfuron)、氟噻草胺(flufenacet)、氟苯吡草(flufenican)、氟吡啶草酯(flufenpyr)、flupropacil、四氟丙酸(flupropanate)、氟胺草唑(flupoxam)、丙炔氟草胺(flumioxazin)、氟烯草酸(flumiclorac)、氟亚胺草酯(flumiclorac-pentyl)、炔草胺

(flumipropyn)、三氟噁嗪(flumezin)、伏草隆(fluometuron)、唑嘧磺草胺(flumetsulam)、氟草酮(fluridone)、呋草酮(flurtamone)、氟草烟(fluroxypyr)、丙草胺(pretilachlor)、扑灭生(proxan)、甘扑津(proglinazine)、环丙腈津(procyazine)、氨基乐灵(prodiamine)、草硫亚胺(prosulfalin)、氟磺隆(prosulfuron)、苜草丹(prosulfocarb)、啶草酯(propaquizafop)、毒草安(propachlor)、扑灭津(propazine)、敌稗(propanil)、炔苯酰草胺(propyzamide)、异丙草胺(propisochlor)、茉莉酮(prohydrojasmon)、噻咪唑嘧磺隆(propyrisulfuron)、苯胺灵(propham)、氟唑草胺(profluzol)、环丙氟灵(profluralin)、调环酸钙(prohexadione-calcium)、丙苯磺隆(propoxycarbazone)、丙苯磺隆(propoxycarbazone-sodium)、环苯草酮(profoxydim)、除草定(bromacil)、溴杀草敏(brompyrazon)、扑草净(prometryn)、扑灭通(prometon)、溴苯腈(bromoxynil)、杀草全(bromfenoxim)、溴丁酰草胺(bromobutide)、溴草腈(bromobonil)、双氟磺草胺(florasulam)、六氯丙酮(hexachloroacetone)、六嗪酮(hexazinone)、烯草胺(pethoxamid)、草除灵(benazolin)、五氟磺草胺(penoxsulam)、克草猛(pebulate)、氟丁酰草胺(beflubutamid)、灭草猛(vernolate)、黄草伏(perfluidone)、bencarbazone、胺酸杀(benzadox)、苜草胺(benzipram)、苜氨基嘌呤(benzylaminopurine)、噻草隆(benzthiazuron)、双苯嘧草酮(benzfendizone)、地散磷(bensulide)、苜嘧磺隆(bensulfuron-methyl)、新燕灵(benzoylprop)、苯并双环酮(benzobicyclon)、吡草酮(benzofenap)、氟草黄(benzofluor)、灭草松(bentazone)、蔬草灭(pentanochlor)、杀草丹(benthio carb)、二甲戊乐灵(pendimethalin)、环戊噁草酮(pentoxazone)、氟草胺(benfluralin)、呋草黄(benfuresate)、杀木膦(fosamine)、氟磺胺草醚(fomesafen)、甲酰氨磺隆(foramsulfuron)、吡效隆(forchlorfenuron)、抑芽丹(maleic hydrazide)、2甲4氯丙酸(mecoprop)、精2甲4氯丙酸(mecoprop-P)、地乐施(medinoterb)、二磺隆(mesosulfuron)、甲基二磺隆(mesosulfuron-methyl)、硝草酮(mesotrione)、灭莠津(mesoprazine)、格草净(methoprotryne)、吡草胺(metazachlor)、灭草定(methazole)、双醚氯吡嘧磺隆(metazosulfuron)、噻唑隆(methabenzthiazuron)、苯嗪草酮(metamitron)、噁唑酰草胺(metamifop)、威百亩(metam)、氟烯硝草(methalpropalin)、灭草恒(methiuron)、异噁唑啉(methiozolin)、甲疏苯威(methiobencarb)、甲基杀草隆(methyldymron)、甲氧隆(metoxuron)、磺草唑胺(metosulam)、甲磺隆(metsulfuron)、甲磺隆(metsulfuron-methyl)、二甲哒草伏(metflurazon)、秀谷隆(metobromuron)、吡喃隆(metobenzuron)、醚草通(methometon)、异丙甲草胺(metolachlor)、赛克津(metribuzin)、缩节胺(mepiquat-chloride)、苯噻草胺(mefenacet)、氟磺酰草胺(mefluidide)、庚酰草胺(monalide)、特噁唑隆(monisouron)、灭草隆(monuron)、一氯乙酸(monochloroacetic acid)、绿谷隆(monolinuron)、草达灭(molinate)、伐草快(morfamquat)、碘甲磺隆(iodosulfuron)、碘甲磺隆甲基钠(iodosulfuron-methyl-sodium)、碘草腈(iodobonil)、碘甲烷(iodomethane)、乳氟禾草灵(lactofen)、利谷隆(linuron)、玉嘧磺隆(rimsulfuron)、环草定(lenacil)、硫氰苯胺(rhodethanil)、过氧化钙(calcium peroxide)、溴化甲烷(methyl bromide)等。

[0114] 此外,作为生物农药,例如通过混合并使用下述物质,能够期待相同的效果:即,核型多角体病毒(Nuclear polyhedrosis virus,NPV)、颗粒体病毒(Granulosis virus,GV)、

质型多角体病毒(Cytoplasmic polyhedrosis virus,CPV)、昆虫痘病毒(Entomopox virus,EPV)等病毒制剂;瘤捕单顶孢菌(Monacrosporium phymatophagum)、小卷蛾斯氏线虫(Steinernema carpocapsae)、昆虫寄生性线虫(Steinernema kushidai)、穿刺芽孢杆菌(Pasteuria penetrans)等用作杀虫或杀线虫剂的微生物农药;木素木霉(Trichoderma lignorum)、放射形土壤杆菌(Agrobacterium radiobactor)、非病原性胡萝卜软腐欧文氏菌(Erwinia carotovora)、枯草芽孢杆菌(Bacillus subtilis)等用作杀菌剂的微生物农药;野油菜黄单胞菌(Xanthomonas campestris)等用作除草剂的生物农药等。

[0115] 进一步,生物农药例如还可与丽蚜小蜂(Encarsia formosa)、科曼尼蚜茧蜂(Aphidius colemani)、食蚜瘿蚊(Aphidoletes aphidimyza)、潜蝇姬小蜂(Diglyphus isaea)、番茄潜蝇离颚茧蜂(Dacnusa sibirica)、智利小植绥螨(Phytoseiulus persimilis)、胡瓜钝绥螨(Amblyseius cucumeris)、东亚小花蝽(Orius sauteri)等天敌生物,布氏白僵菌(Beauveria brongniartii)等微生物农药,醋酸(Z)-10-十四烯酯、(E,Z)-4,10-十四碳二烯乙酸酯、(Z)-8-十二烯基乙酸酯、醋酸(Z)-11-十四烯酯、(Z)-13-二十碳烯-10-酮、14-甲基-1-十八碳烯等信息素剂同时使用。

[0116] 进一步,本发明的通式(1)所表示的具有取代环丙烷噁二唑基的缩合杂环化合物或其盐类还适合驱除寄生在家畜、宠物等动物的体内或体外的寄生虫。动物也可以为不包括人的动物。

以含有本发明的化合物或其盐类作为有效成分为特征的动物用的外部或内部寄生虫防除剂、以及以使用该外部或内部寄生虫防除剂对动物的外部或内部寄生虫进行处理为特征的动物用的外部或内部寄生虫的防除方法也在本发明的范畴内。本发明的化合物通常还可在猫或狗等动物的皮肤上的一处或两处进行点涂或浇注涂布而使用。涂布面积通常为5~10cm²。本发明的化合物优选一旦涂布就遍布动物的整个身体,并且可在不发生结晶化、或者不改变外观或触感的状态下进行干燥。用量根据动物的重量而约为0.1~10ml,特别是对于猫而言优选约为0.5~1ml,对于狗而言优选约为0.3~3ml。

[0117] 关于本发明的外部或内部寄生虫防除剂表现出效力的动物的外部或内部寄生虫,作为蚤目害虫,可列举出人蚤(Pulex irritans)等蚤(Pulex)类、猫栉头蚤(Ctenocephalides felis)、犬栉头蚤(Ctenocephalides canis)等栉头蚤(Ctenocephalides)类、印鼠客蚤(Xenopsylla cheopis)等客蚤(Xenopsylla)类、穿皮潜蚤(Tunga penetrans)等潜蚤(Tunga)类、禽冠蚤(Echidnophaga gallinacea)等冠蚤(Echidnophaga)类、具带病蚤(Nosopsyllus fasciatus)等病蚤(Nosopsyllus)类等。

[0118] 作为虱目害虫,可列举出人头虱(Pediculus humanus capitis)等虱(Pediculus)类、耻阴虱(Phthirus pubis)等阴虱(Phthirus)类、牛血虱(Haematopinus eurysternus)、猪血虱(Haematopinus suis)等血虱(Haematopinus)类、山羊毛虱(Damalinia ovis)、牛毛虱(Damalinia bovis)等毛虱(Damalinia)类、牛颞虱(Linognathus vituli)、羊颞虱(Linognathus ovillus)等颞虱(Linognathus)类、水牛盲虱(Solenopotes capillatus)等盲虱(Solenopotes)类等。

[0119] 作为食毛目害虫,可列举出鸡羽虱(Menopon gallinae)等禽羽虱(Menopon)类、毛羽虱类(Trimenopon spp.)、鸭虱类(Trinoton spp.)、犬啮毛虱(Trichodectes canis)等啮毛虱(Trichodectes)类、猫羽虱(Felicola subrostratus)等猫羽虱(Felicola)类、牛毛

虱 (*Bovicola bovis*) 等牛羽虱 (*Bovicola*) 类、鸡体虱 (*Menacanthus stramineus*) 等体虱 (*Menacanthus*) 类、*Werneckiella* spp.、*Lepikentron* spp. 等。

[0120] 作为半翅目害虫,可列举出温带臭虫 (*Cimex lectularius*)、热带臭虫 (*Cimex hemipterus*) 等臭虫 (*Cimex*) 类、*Reduvius senilis* 等猎蝽 (*Reduvius*) 类、轮背猎蝽 (*Arilus critatus*) 等齿背猎蝽 (*Arilus*) 类、长红猎蝽 (*Rhodnius prolixus*) 等长红猎蝽 (*Rhodnius*) 类、红带锥蝽 (*Triatoma rubrofasciata*) 等锥猎蝽 (*Triatoma*) 类、锥蝽类 (*Panstrongylus* spp.) 等。

[0121] 作为蜱螨目害虫,可列举出美洲钝眼蜱 (*Amblyomma americanum*)、斑点钝眼蜱 (*Amblyomma maculatum*) 等钝眼蜱 (*Amblyomma*) 类、微小牛蜱 (*Boophilus microplus*)、具环牛蜱 (*Boophilus annulatus*) 等牛蜱 (*Boophilus*) 类、变异革蜱 (*Dermacentor variabilis*)、中国台湾革蜱、安氏革蜱 (*Dermacentor andersoni*) 等革蜱 (*Dermacentor*) 类、长角血蜱 (*Haemaphysalis longicornis*)、褐黄血蜱 (*Haemaphysalis flava*)、何氏血蜱 (*Haemaphysalis campanulata*) 等血蜱 (*Haemaphysalis*) 类、卵形硬蜱 (*Ixodes ovatus*)、森林硬蜱 (*Ixodes persulcatus*)、肩突硬蜱 (*Ixodes scapularis*)、太平洋硬蜱 (*Ixodes pacificus*)、全环硬蜱 (*Ixodes holocyclus*) 等硬蜱 (*Ixodes*) 类、血红扇头蜱 (*Rhipicephalus sanguineus*)、具尾扇头蜱 (*Rhipicephalus appendiculatus*) 等扇头蜱 (*Rhipicephalus*) 类、波斯锐缘蜱 (*Argas persicus*) 等锐缘蜱 (*Argas*) 类、赫氏钝缘软蜱 (*Ornithodoros hermsi*)、回归热钝缘蜱 (*Ornithodoros turicata*) 等钝缘蜱 (*Ornithodoros*) 类、绵羊痒螨 (*Psoroptes ovis*)、马痒螨 (*Psoroptes equi*) 等痒螨类、突变膝螨 (*Knemidocoptes mutans*) 等膝螨 (*Knemidocoptes*) 类、猫疥癣虫 (*Notoedres cati*)、鼠疥癣虫 (*Notoedres muris*) 等疥癣虫 (*Notoedres*) 类、人疥螨 (*Sarcoptes scabiei*) 等疥螨 (*Sarcoptes*) 类、耳痒螨 (*Otodectes cynotis*) 等耳螨 (*Otodectes*) 类、兔囊凸牦螨 (*Listrophorus gibbus*) 等 *Listrophorus* 类、皮螨类 (*Chorioptes* spp.)、颈下螨类 (*Hypodectes* spp.)、翅螨类 (*Pterolichus* spp.)、胞螨类 (*Cytodites* spp.)、鸡雏螨类 (*Laminosioptes* spp.)、鸡皮刺螨 (*Dermanyssus gallinae*) 等皮刺螨 (*Dermanyssus*) 类、林禽刺螨 (*Ornithonyssus sylviarum*)、柏氏禽刺螨 (*Ornithonyssus bacoti*) 等禽刺螨 (*Ornithonyssus*) 类、雅氏瓦螨 (*Varroa jacobsoni*) 等瓦螨 (*Varroa*) 类、牙氏姬螯螨 (*Cheyletiella yasguri*)、布氏姬螯螨 (*Cheyletiella blakei*) 等姬螯螨 (*Cheyletiella*) 类、禽螯螨类 (*Ornithocheyletia* spp.)、犬脂螨 (*Demodex canis*)、猫脂螨 (*Demodex cati*) 等脂螨 (*Demodex*) 类、鼠螨类 (*Myobia* spp.)、疮螨类 (*Psorergates* spp.)、红恙螨 (*Trombicula akamushi*)、苍白恙螨 (*Trombicula pallida*)、小板恙螨 (*Trombicula scutellaris*) 等恙螨 (*Trombicula*) 类,优选蚤目害虫、虱目害虫或蜱螨目害虫。

[0122] 作为为本发明的外部或内部寄生虫防除剂的给药对象的动物,可列举出能够成为所述动物的外部或内部寄生虫的宿主的动物,通常可列举出作为家畜、宠物而被饲养的恒温动物及变温动物。作为恒温动物,例如可列举出作为哺乳动物的牛、水牛、绵羊、山羊、猪、骆驼、鹿、麝鹿、驯鹿、马、驴、狗、猫、兔、雪貂、小鼠、大鼠、仓鼠、松鼠、猴等,进一步可列举出作为毛皮动物的水貂、绒鼠 (*chinchilla*)、浣熊等,可列举出作为鸟类的鸡、鹅、火鸡、鸭、鸽子、鹦鹉、鹌鹑等。作为变温动物,例如可列举出作为爬行类的陆龟、海龟、绿海龟、星点龟、蜥蜴、鬣蜥、变色龙、壁虎、蟒蛇、游蛇、眼镜蛇等,优选为恒温动物,更优选为狗、猫、牛、马、

猪、绵羊、山羊等哺乳动物。

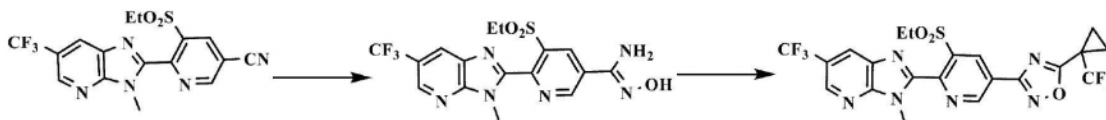
[0123] 由于本发明的防除剂具有不对天敌生物及益虫(以下,也称为非目标生物)造成伤害或产生影响等特征,因此能够合理地多种害虫防除法等进行组合。

[0124] 其中,作为非目标生物,可列举出智利小植绥螨(*Phytoseiulus persimilis*)、加州新小植绥螨(*Amblyseius (Neoseiulus) californicus* (McGregor))、斯氏钝绥螨(*Amblyseius swirskii* (Athias-Henriot))、长毛捕植螨(*Amblyseius longispinosus*)、*Typhlodromus vulgaris* Ehara等天敌生物或蜜蜂、西方蜜蜂、熊蜂、欧洲熊蜂、角额壁蜂、蚕蛾等益虫。

[0125] 以下通过本发明的代表性化合物及制备中间体的制备例进行进一步详细的说明,但本发明并不受这些例子的限定。

实施例

[0126] 制备实施例1.3- (5-乙基磺酰基-6- (3-甲基-6-三氟甲基-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基)吡啶-3-基)-5- (1-三氟甲基环丙基)-1,2,4-噁二唑的制备方法(化合物编号1-4)
[化学式5]

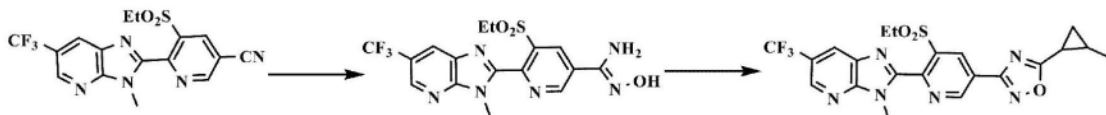


将5-乙基磺酰基-6- (3-甲基-6-三氟甲基-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基)烟腈(1.00g)溶解在乙醇(10mL)中,添加三乙胺(0.71mL)、羟胺盐酸盐(0.26g),以80℃搅拌1小时。加入水,使用乙酸乙酯进行提取。使用无水硫酸钠对有机层进行干燥,在减压下进行浓缩,得到5-(乙基磺酰基)-N'-羟基-6- (3-甲基-6-三氟甲基-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基)吡啶-3-甲脒。

不对其进行纯化,用于下一反应。将所得到的粗产物中的0.15g溶解在THF(四氢呋喃,3mL)中,添加三乙胺(0.10g)、1-(三氟甲基)环丙烷甲酰氯(0.067g),在室温下搅拌1小时。在减压下对反应溶液进行浓缩。将其溶解在乙酸(1mL)中,然后将乙酸溶液溶解在甲苯(2mL)中,以120℃搅拌1小时。加入饱和碳酸钠水溶液,使用乙酸乙酯进行提取。在使用无水硫酸镁对有机层进行干燥之后,进行减压浓缩。通过柱层析对所得到的粗产物进行纯化,得到目标产物(0.056g,30%)。

物性:熔点:151-152℃

[0127] 制备实施例2.3- (5-乙基磺酰基-6- (3-甲基-6-三氟甲基-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基)吡啶-3-基)-5- (2-甲基环丙基)-1,2,4-噁二唑的制备方法(化合物编号1-6)
[化学式6]



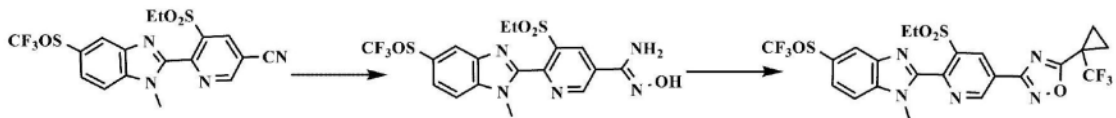
将5-乙基磺酰基-6- (3-甲基-6-三氟甲基-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基)烟腈(1.00g)溶解在乙醇(10mL)中,添加三乙胺(0.71mL)、羟胺盐酸盐(0.26g),以80℃搅拌1小时。加入水,使用乙酸乙酯进行提取。使用无水硫酸钠对有机层进行干燥,在减压下进行浓缩,得到5-乙基磺酰基-N'-羟基-6- (3-甲基-6-三氟甲基-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基)吡啶-3-甲脒。不对其进行纯化,用于下一反应。

将所得到的粗产物中的0.15g溶解在THF (3mL) 中, 添加三乙胺 (0.10g)、2-甲基环丙烷-1-甲酰氯 (0.046g), 在室温下搅拌1小时。在减压下对反应溶液进行浓缩。将其溶解在乙酸 (1mL) 中, 然后将乙酸溶液溶解在甲苯 (2mL) 中, 以120°C 搅拌1小时。加入饱和碳酸钠水溶液, 使用乙酸乙酯进行提取。在使用无水硫酸镁对有机层进行干燥之后, 进行减压浓缩。通过柱层析对所得到的粗产物进行纯化, 得到目标产物 (0.058g, 34%)。

物性: 熔点: 150-151°C

[0128] 制备实施例3.3- (5-乙基磺酰基-6- (1-甲基-5-三氟甲基亚磺酰基)-1H-苯并[d]咪唑-2-基) 吡啶-3-基)-5- (1-三氟甲基环丙基)-1,2,4-噁二唑的制备方法 (化合物编号1-8)

[化学式7]



将5-乙基磺酰基-6- (1-甲基-5-三氟甲基亚磺酰基)-1H-苯并[d]咪唑-2-基) 烟腈 (0.51g) 溶解在乙醇 (10mL) 中, 添加三乙胺 (0.32mL)、羟胺盐酸盐 (0.12g), 以80°C 搅拌1小时。加入水, 使用乙酸乙酯进行提取。使用无水硫酸钠对有机层进行干燥, 在减压下进行浓缩, 得到5-乙基磺酰基-N'-羟基-6- (1-甲基-5-三氟甲基亚磺酰基)-1H-苯并[d]咪唑-2-基) 吡啶-3-甲脒。不对其进行纯化, 用于下一反应。

将所得到的粗产物中的0.15g溶解在THF (3mL) 中, 添加三乙胺 (0.10g)、1- (三氟甲基) 环丙烷甲酰氯 (0.067g), 在室温下搅拌1小时。在减压下对反应溶液进行浓缩。将其溶解在乙酸 (1mL) 中, 然后将乙酸溶液溶解在甲苯 (2mL) 中, 以120°C 搅拌1小时。加入饱和碳酸钠水溶液, 使用乙酸乙酯进行提取。在使用无水硫酸镁对有机层进行干燥之后, 进行减压浓缩。通过柱层析对所得到的粗产物进行纯化, 得到目标产物 (0.090g, 48%)。

物性: 熔点: 140-141°C

[0129] 以下, 示出制剂的实施例, 但并不限于此。制剂例中的份表示重量份。

[0130] 制剂例1.

本发明的化合物	10份
二甲苯	70份
N-甲基吡咯烷酮	10份
聚氧乙烯壬基苯基醚与 烷基苯磺酸钙的混合(重量比 1:1)	10份

将以上物质均匀地混合溶解, 制成乳剂。

[0131] 制剂例2.

本发明的化合物	3份
黏土粉末	82份
硅藻土粉末	15份

将以上物质均匀地混合粉碎, 制成粉剂。

- [0132] 制剂例3.
 本发明的化合物 5份
 膨润土与黏土的混合粉末 90份
 木质素磺酸钙 5份
 将以上物质均匀地混合,加入适量的水进行捏合、造粒、干燥,制成颗粒剂。
- [0133] 制剂例4.
 本发明的化合物 20份
 高岭土与合成高分散硅酸的混合 75份
 聚氧乙烯壬基苯基醚与
 烷基苯磺酸钙的混合(重量比1:1) 5份
 将以上物质均匀地混合粉碎,制成可湿性粉剂。
- [0134] 制剂例5.
 本发明的化合物 20份
 聚氧乙烯月桂醚 3份
 磺基琥珀酸钠二辛酯 3.5份
 二甲基亚砷 37份
 2-丙醇 36.5份
 将以上物质均匀地混合溶解,制成水溶性液体制备物。
- [0135] 制剂例6.
 本发明的化合物 2份
 二甲基亚砷 10份
 2-丙醇 35份
 丙酮 53份
 将以上物质均匀地混合溶解,制成喷雾用液体制剂。
- [0136] 制剂例7.
 本发明的化合物 5份
 己二醇 50份
 异丙醇 45份
 将以上物质均匀地混合溶解,制成经皮给药用液体制剂。
- [0137] 制剂例8.
 本发明的化合物 5份
 丙二醇单甲醚 50份
 二丙二醇 45份
 将以上物质均匀地混合溶解,制成经皮给药用液体制剂。
- [0138] 制剂例9.
 本发明的化合物 2份

- 轻质液体石蜡 98份
将以上物质均匀地混合溶解,制成经皮给药(浇泼)用液体制剂。
- [0139] 制剂例10.
- | | |
|---|-----|
| 本发明的化合物 | 2份 |
| 轻质液体石蜡 | 58份 |
| 橄榄油 | 30份 |
| 中链脂肪酸甘油三酯(ODO-H: The Nisshin OilliO Group, Ltd. 制造) | 9份 |
| 有机硅类消泡剂(商品名称: Shin-Etsu Silicone, Shin-Etsu Chemical Co., Ltd.制造) | 1份 |
- 将以上物质均匀地混合溶解,制成经皮给药(浇泼)用液体制剂。
- [0140] 接着,示出本发明的试验例,但并不限于此。
- [0141] 试验例1.
- 对桃蚜(*Myzus persicae*)的防除率试验
- 在直径8cm、高8cm的塑料盆中种植白菜,使桃蚜繁殖,调查各盆的寄生虫数。按照制剂例1对本发明的通式(1)的化合物进行制剂,将制成的制剂分散于水中,稀释成500ppm的药液,将该药液散布在盆植白菜的茎叶上,风干后,将盆保管于温室中,在散布药剂后第6天调查寄生在各个白菜上的桃蚜的寄生虫数,通过下述式计算防除率,按照下述判定标准进行判定。
- [0142] [数学式1]
- $$\text{防除率} = 100 - \left\{ \frac{T \times Ca}{Ta \times C} \right\} \times 100$$
- [0143] Ta:处理区的散布前寄生虫数
T:处理区的散布后寄生虫数
Ca:未处理区的散布前寄生虫数
C:未处理区的散布后寄生虫数
- [0144] 判定标准
- A . . . 防除率100%
 - B . . . 防除率99%~90%
 - C . . . 防除率89%~80%
 - D . . . 防除率79%~50%
- [0145] 其结果,本发明化合物的1-2、1-4、1-5、1-6、1-7及1-8表现出A的活性。
- [0146] 试验例2.对灰飞虱(*Laodelphax striatella*)的杀虫试验
- 按照制剂例1对本发明的通式(1)的化合物进行制剂,将制成的制剂分散于水中,稀释成500ppm的药液,将稻苗(品种:日本晴)在该药液中浸渍30秒,风干后,放入玻璃试管中,各接种10只三龄灰飞虱后,塞入棉栓,调查接种8天后的生死虫数,通过下述式计算校正死虫率,按照试验例1的判定标准进行判定。

[0147] [数学式2]

$$\text{校正死虫率 (\%)} = \frac{(\text{未处理区生存率} - \text{处理区生存率})}{\text{未处理区生存率}} \times 100$$

[0148] 其结果,本发明化合物的1-2、1-4、1-5、1-6、1-7及1-8表现出A的活性。

[0149] 试验例3.对小菜蛾 (*Plutella xylostella*) 的杀虫试验

在白菜苗上放养小菜蛾的成虫,使其产卵,在放养2天后,将带有产下的卵的白菜苗在药液中浸渍约30秒,风干后,静置在25℃的恒温室中,所述药液通过按照制剂例1对本发明的通式(1)的化合物进行制剂,并将以制成的制剂为有效成分的药剂稀释成500ppm而得到。在该药液中浸渍6天后,调查孵化虫数,通过下述式计算出死虫率,按照试验例1的判定标准进行判定。1区10只重复3次。

[0150] [数学式3]

$$\text{校正死虫率 (\%)} = \frac{\text{未处理区孵化虫数} - \text{处理区孵化虫数}}{\text{未处理区孵化虫数}} \times 100$$

[0151] 其结果,本发明化合物的1-2、1-4、1-5、1-6、1-7及1-8表现出A的活性。

[0152] 试验例4.对捻转血矛线虫 (*Haemonchus contortus*) 幼虫活动的影响评价试验

向含有规定的调整液的96孔板的每1个孔中,加入本发明的化合物的DMSO稀释溶液,使最终浓度为50ppm。放养20只捻转血矛线虫的第1期幼虫,静置4天后,调查其活动能力。以仅因DMSO溶液导致的阻碍力为标准,校正、计算出各处理区的活动阻碍率。

[0153] 其结果,本发明化合物的1-2、1-4、1-5、1-6及1-7表现出50%以上的校正活动阻碍率。

[0154] 试验例5.对犬恶丝虫 (*Dirofilaria immitis*) 幼虫活动的影响评价试验将稀释于规定的调整液的500只犬恶丝虫的第1期幼虫接种在96孔板的每1个孔中,并加入本发明的化合物的DMSO稀释溶液,使最终浓度为50ppm。然后,静置3天,调查其活动能力。以仅因DMSO溶液导致的阻碍力为标准,校正、计算出各处理区的活动阻碍率。

[0155] 其结果,本发明化合物的1-2、1-4、1-5、1-6及1-7表现出50%以上的校正活动阻碍率。

[0156] 试验例6.对猫栳头蚤 (*Ctenocephalides felis*) 成虫的口服活性评价试验

将10只羽化后的猫栳头蚤的新成虫放入试验笼中,使用供给装置,将加入本发明的化合物的DMSO稀释溶液并将最终浓度调整至50ppm的牛血液进行口服给药。1天后,调查其死亡率。另外,将异常个体分类为死亡。

[0157] 其结果,本发明化合物的1-2、1-4及1-7表现出50%以上的死亡率。

[0158] 试验例7.对血红扇头蜱 (*Rhipicephalus sanguineus*) 若虫的经皮活性评价试验

在被赋予了通气功能的样品瓶内,对向本发明的化合物的DMSO稀释溶液中加入 acetone/triton (丙酮/曲拉通) 的混合溶液并将最终浓度调整至100ppm的溶液进行处理。干燥一晚后,放养10只血红扇头蜱的若虫,2天后调查其死亡率。另外,将异常个体分类为死亡。

[0159] 其结果,本发明化合物的1-4及1-5表现出50%以上的死亡率。

工业实用性

[0160] 本发明的化合物对大范围的农业园艺用害虫及动物的内部寄生虫及外部寄生虫具有优异的防除效果,是有用的。