



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 101119961 B

(45) 授权公告日 2010.05.19

- (21) 申请号 200680005094.5
- (22) 申请日 2006.06.15
- (66) 本国优先权数据
200510046765.X 2005.06.28 CN
- (85) PCT申请进入国家阶段日
2007.08.16
- (86) PCT申请的申请数据
PCT/CN2006/001337 2006.06.15
- (87) PCT申请的公布数据
W02007/000098 ZH 2007.01.04
- (73) 专利权人 中国中化集团公司
地址 北京市复兴门外大街A2号中化大厦
专利权人 沈阳化工研究院
- (72) 发明人 刘长令 迟会伟 崔东亮 李淼
李志念 罗艳梅 袁静
- (74) 专利代理机构 沈阳科苑专利商标代理有限公司 21002
代理人 周秀梅 何薇
- (51) Int. Cl.
C07C 69/54 (2006.01)
C07C 251/48 (2006.01)
C07C 271/28 (2006.01)
C07C 59/68 (2006.01)
C07D 239/52 (2006.01)

- C07D 273/01 (2006.01)
- A01N 37/10 (2006.01)
- A01N 37/18 (2006.01)
- A01N 37/50 (2006.01)
- A01N 43/54 (2006.01)
- A01N 43/88 (2006.01)
- (56) 对比文件
CN 1047286 A, 1990.11.28, 说明书第1页第3段至第2页第1段, 第6页表1, 第27页第1段, 第2段, 第3段, 第31页第2段, 第33页第1段, 第35页第4段.
US 5221762 A, 1993.06.22, 说明书第1栏第1段至第83栏第1段.
CN 1030749 A, 1989.02.01, 说明书第6页第3段, 第12页表1, 第44页第1段, 第45页第6段, 第48页第2段.
US 5824705 A, 1998.10.20, 说明书第1栏第1段, 第124栏至第125栏表8.
Hideyuki TAKENAKA, et al.. Fungicidal Activities of 2-(SubstitutedPhenoxy)methyl phenyl-2-methoxyiminoacetamide Derivatives. Journal of pesticide science 23 2. 1998, 23(2), 107-112.

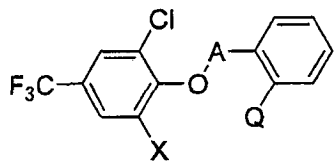
审查员 刘红彦

权利要求书 1 页 说明书 10 页

(54) 发明名称
取代的对三氟甲基苯醚类化合物及其制备与应用

(57) 摘要

本发明公开了一种取代的对三氟甲基苯醚类化合物及其制备与应用。结构如通式 I 所示：



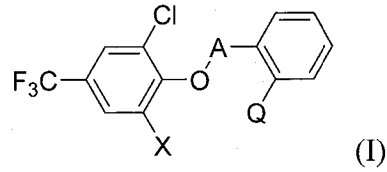
各取代基定义见

(I)

合物具有很高的生物活性使得在很低的剂量下就可以获得很好的效果。本发明的化合物同时具有很好的杀虫活性,对多种害虫特别对朱砂叶螨有特效,适合于对多种作物上害虫的综合防治。

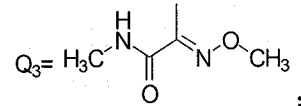
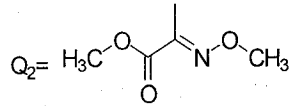
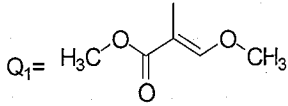
说明书。本发明的化合物具有广谱活性,可用于防治在各种作物上由卵菌纲、担子菌纲、子囊菌和半知菌类等多种病菌引起的病害,而且由于这些化

1. 一种取代的对三氟甲基苯醚类化合物,如通式(I)所示:



式中:

Q 选自如下所示的 Q_1 、 Q_2 或 Q_3



A 选自 CH_2 ;

X 选自氢。

2. 一种按权利要求 1 所述的化合物在防治作物上害虫的应用。
3. 一种按权利要求 1 所述的化合物在防治作物上病菌的应用。
4. 一种杀虫、杀菌组合物,其特征在于:组合物中含有权利要求 1 所述的化合物和农业上可接受的载体,组合物中活性组分的重量百分含量为 0.1-99%。

取代的对三氟甲基苯醚类化合物及其制备与应用

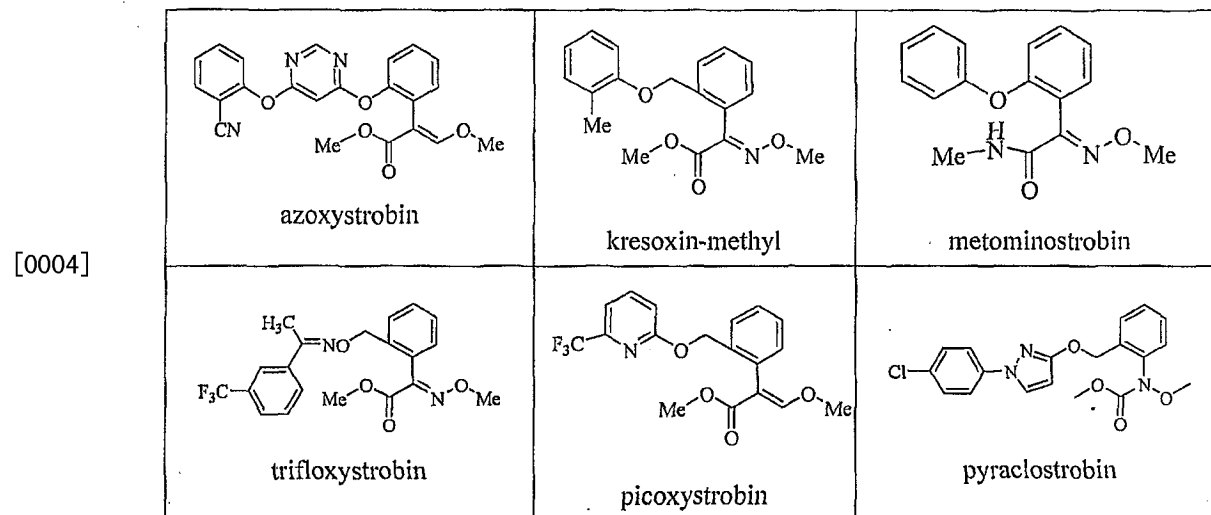
技术领域

[0001] 本发明属农用杀虫、杀菌剂领域，具体地涉及一种取代的对三氟甲基苯醚类化合物及其制备与应用。

背景技术

[0002] 由于氟原子具有良好的模拟效应、电子效应、阻碍效应、渗透效应等特殊性质，因此，它的引入可使化合物的活性倍增。近几年含氟农药新品种不断涌现，在新农药品种中所占比例越来越高。

[0003] 甲氧基丙烯酸酯化合物是已知的具有生物活性的化合物。报道的专利很多如 EP335519、US4829085、US4914128、US5145980、US5157144、US5334748、US5395854、US6653258、US2004029944、W02003087032 等，已知商品化的品种也很多，部分商品化的品种的结构与名称如下：



[0005] 尽管有很多种关于此类的专利与商品化品种，但本发明所涉及的取代的对三氟甲基苯醚类化合物目前尚没有公开。

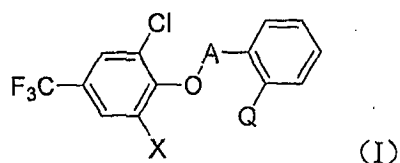
发明内容

[0006] 本发明的目的在于提供一种在很小的剂量下就可以控制各种病虫害的取代的对三氟甲基苯醚类化合物，它可应用于农业上以防治作物的病害和虫害。

[0007] 本发明的技术方案如下：

[0008] 本发明提供一种取代的对三氟甲基苯醚类化合物，如通式 (I) 所示：

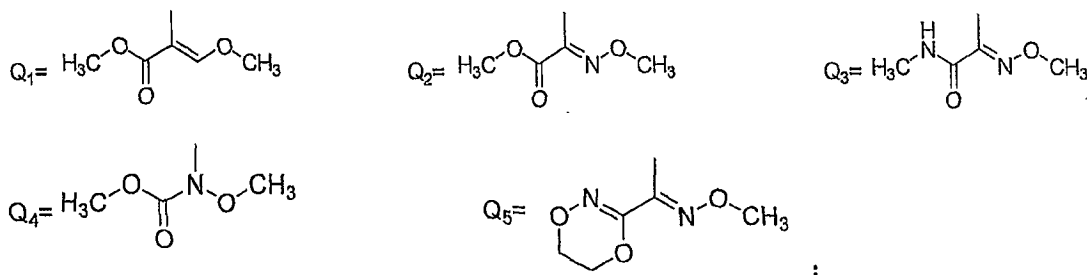
[0009]



[0010] 式中：

[0011] Q 选自如下所示的 Q_1 、 Q_2 、 Q_3 、 Q_4 或 Q_5

[0012]



[0013] A 选自 CH_2 或 ；

[0014] 当 $A =$ 时，嘧啶的 4-位与氧相连，6-位氧与苯环相连， $Q = Q_1$ ；

[0015] X 选自氢、卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_{12} 烷基、 C_2 - C_{12} 烯基、 C_2 - C_{12} 炔基、 C_1 - C_{12} 卤代烷基、 C_1 - C_{12} 烷氧基、 C_1 - C_{12} 烷硫基、 C_1 - C_{12} 烷磺酰基、 C_1 - C_{12} 烷基羰基、 C_1 - C_{12} 烷氧基 C_1 - C_{12} 烷基、 C_1 - C_{12} 烷氧基羰基、 C_1 - C_{12} 烷氧基羰基 C_1 - C_{12} 烷基、 C_1 - C_{12} 卤代烷氧基 C_1 - C_{12} 烷基、任意取代胺基 C_1 - C_{12} 烷基、任意取代的芳氧基、任意取代的芳 C_1 - C_{12} 烷基氧基、任意取代的芳基、杂芳基、任意取代的芳基 C_1 - C_{12} 烷基、杂芳基 C_1 - C_{12} 烷基或杂芳基 C_1 - C_{12} 烷氧基 ；

[0016] 及其立体异构体。

[0017] 本发明中较为优选的化合物为：通式 (I) 中，Q 选自 Q_1 、 Q_2 、 Q_3 、 Q_4 或 Q_5 ；A 选自 CH_2

或 ；当 $A =$ 时，嘧啶的 4-位与氧相连，6-位氧与苯环相连， $Q = Q_1$ ；X

选自氢、卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 烷磺酰基、 C_1 - C_6 烷基羰基、 C_1 - C_6 烷氧基 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基羰基、 C_1 - C_6 烷氧基羰基 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基 C_1 - C_6 烷基、取代的胺基 C_1 - C_6 烷基、取代的芳氧基、取代的芳 C_1 - C_6 烷基氧基、取代的芳基、杂芳基、取代的芳基 C_1 - C_6 烷基、杂芳基 C_1 - C_6 烷基或杂芳基 C_1 - C_6 烷氧基。

[0018] 进一步优选的化合物为：通式 (I) 中，Q 选自 Q_1 、 Q_2 、 Q_3 、 Q_4 或 Q_5 ；A 选自 CH_2 或

；当 $A =$ 时，嘧啶的 4-位与氧相连，6-位氧与苯环相连， $Q = Q_1$ ；X 选

自氢、卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 烷磺酰基、 C_1 - C_6 烷基羰基、 C_1 - C_6 烷氧基 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基羰基、 C_1 - C_6 烷氧基羰基 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 卤代烷氧基 C_1 - C_3 烷基、取代的胺基 C_1 - C_3 烷基、取代或未取代的下述基团：苯基、苯氧基、苄基或苄氧基。

[0019] 更进一步优选的化合物为：通式 (I) 中，Q 选自 Q_1 、 Q_2 、 Q_3 、或 Q_4 ；A 选自 CH_2 或

；当 $A =$ 时，嘧啶的 4-位与氧相连，6-位氧与苯环相连， $Q = Q_1$ ；X 选

自氢、氯、溴、氟、氰基或 C_1-C_3 烷基。

[0020] 上面给出的通式 (I) 化合物的定义中, 汇集所用术语一般代表如下取代基:

[0021] 卤: 指氟、氯、溴和碘。

[0022] 烷基: 直链或支链烷基, 例如甲基、乙基、丙基、异丙基和叔丁基。

[0023] 卤代烷基: 直链或支链烷基, 在这些烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代, 例如, 卤代烷基诸如氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基。

[0024] 烷氧基: 直链或支链烷基, 经氧原子键连接到结构上。

[0025] 卤代烷氧基: 直链或支链烷氧基, 在这些烷氧基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。例如, 卤代烷氧基诸如氯甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基。

[0026] 链烯基: 直链或支链并可在任何位置上存在有双键, 例如乙烯基、烯丙基。取代链烯基包括任意取代的芳基链烯基。

[0027] 炔基: 直链或支链并可在任何位置上存在有三键, 例如乙炔基、炔丙基。取代炔基包括任意取代的芳炔基。

[0028] 芳基以及芳烷基、芳基链烯基、芳炔基、芳氧基和芳氧基烷基中的芳基部分包括苯基和萘基。

[0029] 本发明中所指杂芳基是含 1 个或多个 N、O、S 杂原子的 5 元环或 6 元环。例如吡啶、呋喃、嘧啶、吡嗪、哒嗪、三嗪、喹啉或苯并呋喃。

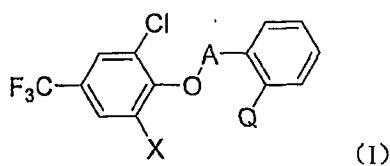
[0030] 所谓“取代的”选自烷基、烷氧基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤素、硝基、CN 等等取代基。

[0031] 本发明的化合物中, 由于碳-碳双键和碳-氮双键连接不同的取代基而可以形成几何异构体 (分别以 Z 和 E 来表示不同的构型)。本发明的通式 (I) 化合物包括 Z 型异构体和 E 型异构体及其任何比例的 Z 型异构体和 E 型异构体混合物。

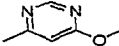
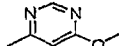
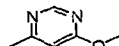
[0032] 可以用下面表 1 中列出的化合物来说明本发明, 但并不限定本发明。

[0033] 表 1 化合物表

[0034]

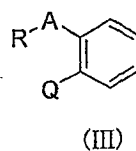
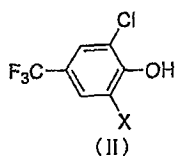


[0035]

化合物编号	A	X	Q
1	CH ₂	H	Q ₁
2	CH ₂	Cl	Q ₁
3	CH ₂	CH ₃	Q ₁
4	CH ₂	H	Q ₂
5	CH ₂	Cl	Q ₂
6	CH ₂	CH ₃	Q ₂
7	CH ₂	H	Q ₃
8	CH ₂	Cl	Q ₃
9	CH ₂	CH ₃	Q ₃
10	CH ₂	H	Q ₄
11	CH ₂	Cl	Q ₄
12	CH ₂	CH ₃	Q ₄
13	CH ₂	H	Q ₅
14	CH ₂	Cl	Q ₅
15	CH ₂	CH ₃	Q ₅
16		H	Q ₁
17		Cl	Q ₁
18		CH ₃	Q ₁
19	CH ₂	F	Q ₁
20	CH ₂	OCH ₃	Q ₁
21	CH ₂	CN	Q ₁

[0036] 本发明还包括通式 (I) 化合物的制备方法：由通式 (II) 所示的取代的苯酚类化合物和通式 (III) 所示的苯卤在碱性条件下、于有机溶剂中反应制得。

[0037]



[0038] 式中，R 是离去基团，选自卤素（氯、溴或碘）；其他各基团的定义同上。

[0039] 制备通式 (I) 化合物的反应式如下：

[0040]

[0055] 杀虫、杀菌组合物通常加工成浓缩物的形式并以此用于运输,在施用之前由使用者将其稀释。少量的表面活性剂载体的存在有助于稀释过程。这样,按照本发明的组合物中至少有一种载体优选是表面活性剂。例如组合物可含有至少两种载体,其中至少一种是表面活性剂。

[0056] 表面活性剂可以是乳化剂、分散剂或润湿剂;它可以是非离子的或离子的表面活性剂。合适的表面活性剂的例子包括聚丙烯酸和木质素磺酸的钠盐或钙盐;分子中含至少12个碳原子的脂肪酸或脂肪胺或酰胺与环氧乙烷和/或环氧丙烷的缩合物。甘醇、山梨醇、蔗糖或季戊四醇脂肪酸酯及这些酯与环氧乙烷和/或环氧丙烷的缩合物;脂肪醇或烷基苯酚如对辛基苯酚或对辛基甲苯酚与环氧乙烷和/或环氧丙烷的缩合物;这些缩合产物的硫酸盐和磺酸盐;在分子中至少含有10个碳原子的硫酸或磺酸酯的碱金属或碱土金属盐,优选钠盐,例如硫酸月桂酸酯钠,硫酸仲烷基酯钠,磺化蓖麻油钠盐,磺酸烷基芳基酯钠,如十二烷基苯磺酸钠盐。

[0057] 本发明的组合物的实例是可湿性粉剂、粉剂、颗粒剂和溶液,可乳化的浓缩剂、乳剂、悬浮浓缩剂、气雾剂和烟雾剂。可湿性粉剂通常含25%,50%或75%重量活性成分,且通常除固体惰性载体之外,还含有3-10%重量的分散剂,且若需要可加入0-10%重量的稳定剂和/或其它添加剂如渗透剂或粘着剂。粉剂通常可成型为具有与可湿性粉剂相似的组成但没有分散剂的粉剂浓缩剂,再进一步用固体载体稀释,得到通常含0.5-10%重量活性组分的组合物。粒剂通常制备成具有10.至100目(1.676-0.152mm)大小,且可用成团或注入技术制备。通常粒剂含0.5-75%重量的活性成分和0-10%重量添加剂如稳定剂、表面活性剂、缓释改良剂。所谓的“可流动干粉”由具有相对高浓度活性成分的相对小的颗粒组成。可乳化浓缩剂除溶剂外,当需要时通常含有共溶剂,1-50% W/V 活性成分,2-20% W/V 乳化剂和0-20% W/V 其他添加剂如稳定剂、渗透剂和腐蚀抑制剂。悬浮浓缩剂通常含有10-75%重量的活性成分、0.5-15%重量的分散剂、0.1-10%重量的其它添加剂如消泡剂、腐蚀抑制剂、稳定剂、渗透剂和粘着剂。

[0058] 水分散剂和乳剂,例如通过用水稀释按照本发明的可湿性粉剂或浓缩物得到的组合物,也列入本发明范围。所说的乳剂可具有油包水或水包油两个类型。

[0059] 通过在组合物中加入其他的一种或多种杀菌剂,使其能比单独的通式(I)化合物具有更广谱的活性。此外,其他杀菌剂可对通式(I)化合物的杀菌活性具有增效作用。也可将通式(I)化合物与其他杀虫剂混用,或同时与另一种杀菌剂以及其他杀虫剂混用。

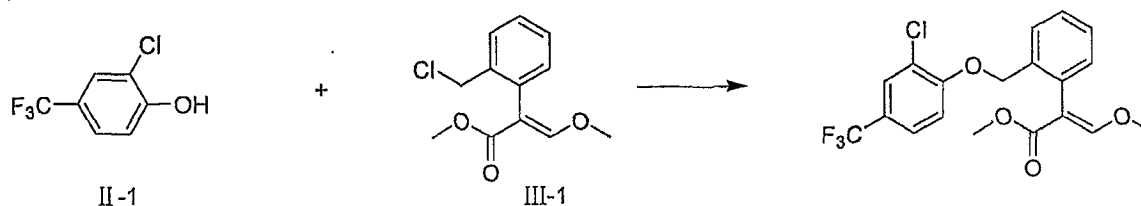
具体实施方式

[0060] 以下具体的实例用来进一步说明本发明,但并不限制本发明。

[0061] 合成实施例

[0062] 实例1:化合物1的制备

[0063]



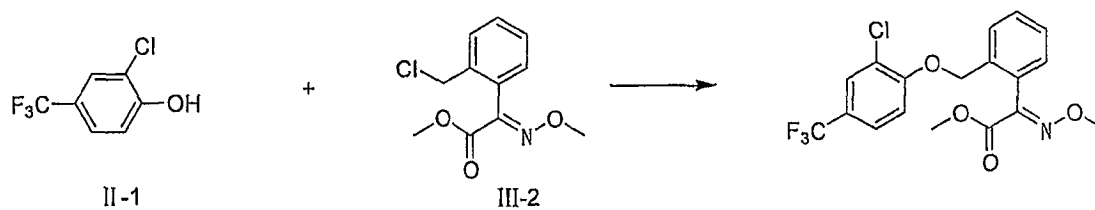
[0064] 室温下,将含有 0.8 克无水碳酸钾、0.39 克 (II-1)、0.4 克 (III-1) 于 20 毫升 N,N-二甲基甲酰胺的混合液加热回流搅拌反应 5 小时,将反应混合物倒入冰水中,乙酸乙酯萃取 3 次,合并萃取液,饱和食盐水洗 3 次,干燥,过滤,减压浓缩,得淡黄色固体为粗产品。用乙酸乙酯和石油醚的混合液 (1 : 8) 柱层析得到标题化合物 0.51 克,熔点 104-106℃。收率 70.5%。

[0065] 核磁数据 ($^1\text{H NMR}$, 300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3) 如下 :

[0066] δ ppm 3.71 (3H, s), 3.83 (3H, s), 5.12 (2H, s), 6.89 (1H, d), 7.20 (1H, t), 7.35 (3H, m), 7.53 (1H, m), 7.62 (2H, s)。

[0067] 实例 2 : 化合物 4 的制备

[0068]



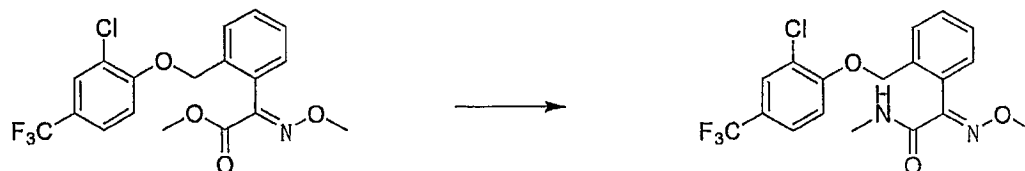
[0069] 室温下,将含有 0.8 克无水碳酸钾、0.39 克 (II-1)、0.42 克 (III-2) 于 20 毫升 N,N-二甲基甲酰胺的混合液加热回流搅拌反应 5 小时,将反应混合物倒入冰水中,乙酸乙酯萃取 3 次,合并萃取液,饱和食盐水洗 3 次,干燥,过滤,减压浓缩,得淡黄色固体为粗产品。用乙酸乙酯和石油醚的混合液 (1 : 8) 柱层析得到标题化合物 0.53 克,熔点 115-116℃。收率 73.2%。

[0070] 核磁数据 ($^1\text{H NMR}$, 300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3) 如下 :

[0071] δ ppm 3.88 (3H, s), 4.04 (3H, s), 5.09 (2H, s), 6.93 (1H, d), 7.22 (1H, d), 7.45 (3H, m), 7.58 (1H, d), 7.63 (1H, s)。

[0072] 实例 3 : 化合物 7 的制备

[0073]



[0074] 将 0.60 克化合物 4 与两倍摩尔比的甲胺水溶液在 50 毫升四氢呋喃中室温搅拌过夜,浓缩后用乙酸乙酯萃取 2 次,合并的提取物用水洗涤 3 次,再用饱和食盐水洗 2 次,干燥,过滤,浓缩,得标题化合物 0.53 克,熔点 92-94℃。收率 88.5%。

[0075] 核磁数据 ($^1\text{H NMR}$, 300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3) 如下 :

[0076] δ ppm 2.92 (3H, s), 3.92 (3H, s), 5.12 (2H, s), 6.95 (1H, d), 7.24 (1H, m), 7.42 (3H,

m), 7.54(1H, d), 7.62(1H, s)。

[0077] 其他化合物参照上述方法合成。

[0078] 部分表 1 中所示的通式 I 化合物的核磁数据 (^1H NMR, 300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3) 如下:

[0079] 化合物 2:油状物。

[0080] 化合物 10:油状物。 δ ppm 3.75(3H, s), 3.83(3H, s), 5.24(2H, s), 7.02(1H, d), 7.42(4H, m), 7.66(2H, t)。

[0081] 化合物 16:熔点 142-144 $^{\circ}\text{C}$ 。 δ ppm 3.61(3H, s), 3.77(3H, s), 6.40(1H, s), 7.20(1H, d), 7.35(3H, m), 7.49(1H, s), 7.61(1H, d), 7.76(1H, d), 8.39(1H, s)。

[0082] 制剂实施例

[0083] (配方中活性组分折百后计量加入, 所示百分数均为重量百分含量)

[0084] 实例 4 60%可湿性粉剂

[0085] 化合物 1 (含量 97.2%) 60%

[0086] 十二烷基萘磺酸钠 2%

[0087] 木质素磺酸钠 9%

[0088] 高岭土 补足至 100%

[0089] 将化合物 1、十二烷基萘磺酸钠、木质素磺酸钠及高岭土(均为固体)混合在一起, 在粉碎机中粉碎, 直到颗粒达到标准。

[0090] 实例 5 35%乳油

[0091] 化合物 4 (含量 98.4%) 35%

[0092] 亚磷酸 10%

[0093] 乙氧基化甘油三酸酯 15%

[0094] 环己酮 补足至 100%

[0095] 亚磷酸溶解在环己酮中, 然后加入化合物 4 和乙氧基化甘油三酸酯, 得到透明的溶液。

[0096] 实例 6 30%悬浮液

[0097] 化合物 7 (含量 96.4%) 30%

[0098] 十二烷基萘磺酸钠 4%

[0099] 半纤维素 2%

[0100] 环氧丙烷 8%

[0101] 水 补足至 100%

[0102] 将化合物 7 与应加水量的 80%的水及十二烷基萘磺酸钠在球磨机中(1mm 珠)中一起粉碎。半纤维素和环氧丙烷溶解在其余 20%的水中, 然后搅拌加入上述组分。

[0103] 实例 7 25%水乳剂

[0104] 化合物 10 (含量 96.2%) 25%

[0105] 十二烷基醇聚乙二醇磷酸酯 4%

[0106] 乙氧基甘油三酸酯 2%

[0107] 十二烷基苯磺酸钙 1.5%

[0108] 环氧甲烷环氧丙烷共聚物 2.5%

[0109] 环己酮 30%

[0110] 烷基芳基馏分 补足至 100%

[0111] 将化合物 10 溶解在 80% 的应加入溶剂量中 (环己酮和烷基芳基馏分), 然后加入乳化剂 (十二烷基醇聚乙二醇磷酸酯、乙氧基甘油三酸酯及十二烷基苯磺酸钙) 和分散剂 (2.5 份环氧甲烷环氧丙烷共聚物), 将混合物彻底搅拌。混合物在球磨机 (1mm 珠) 中粉碎, 然后再加入其余 20% 的溶剂。

[0112] 生物活性测定

[0113] 实例 8 杀菌活性测定

[0114] 用本发明化合物对植物的多种真菌病害进行了活性测定。试验方法如下:

[0115] 保护作用和治疗作用测定采用盆栽测定法。待测化合物原药用少量丙酮溶解, 用含有 0.1% 吐温 80 的水稀释至如下所需的浓度。保护作用测定首先将药液喷雾处理到植物试材上, 24 小时后进行病害接种。接种后, 将植物放在恒温恒湿培养箱中, 使感染继续, 待对照充分发病后 (通常为一周时间) 进行评估调查。治疗作用则首先接种病原菌, 4 天后进行喷雾处理, 待对照充分发病后 (喷雾处理后 3-4 天) 进行评估调查。

[0116] 部分测试结果如下 (所有质量浓度均以有效成分计):

[0117] 400mg/L 时, 对黄瓜霜霉病 (*Pseudoperonospora cubensis*) 防效为 100% 的有化合物 1、4、7。

[0118] 400mg/L 时, 对小麦白粉病 (*Blumeria graminis*) 防效为 100% 有化合物 1、4、7、10、16。

[0119] 200mg/L 时, 对小麦白粉病防效为 100% 的有化合物 1、4、7; 防效大于 95% 的有化合物 10。

[0120] 200mg/L 时, 对小麦根腐病 (*Helminthosporium sativum*)、黄瓜炭疽病 (*Colletotrichum lagenarium*)、小麦颖枯病 (*Septoria nodrum*)、小麦叶锈病 (*Puccinia tritici*)、水稻瘟病 (*Pyricularia oryzae*) 防效大于 95% 的有化合物 1、4、7。

[0121] 12.5mg/L 时, 对小麦白粉病防效为 100% 的有化合物 1、4、7。

[0122] 化合物 1、4、7 与商品化品种醚菌酯 (kresoxin-methyl, 50% 翠贝干悬浮剂, BASF) 对小麦白粉病保护活性比较见表 2。

[0123] 表 2 化合物 1 防治小麦白粉病的保护试验结果

[0124]

化合物	1 天 保护效果 (%)							
	25mg/L	12.5mg/L	6.25mg/L	3.13mg/L	1.56mg/L	0.78mg/L	0.39mg/L	0.19 mg/L
1	100	100	100	100	100	90	55	30
4	100	100	100	100	100	98	90	70
7	100	100	100	100	100	90	85	50
醚菌酯	100	100	98	70	40	15	0	0

[0125] 化合物 1 对小麦白粉病治疗活性见表 3。

[0126] 表 3 化合物 1 防治小麦白粉病的治疗试验结果

化合物	3 天治疗效果 (%)			
	12.5 mg/L	6.25 mg/L	3.125 mg/L	1.56 mg/L
[0127] 1	100	100	80	50
醚菌酯	100	20	15	10

[0128] 实例 9 杀虫杀螨活性测定

[0129] 用本发明化合物对几种昆虫和螨类进行了杀虫活性测定试验。测定的方法如下：

[0130] 新化合物用丙酮 / 甲醇 (1 : 1) 的混合溶剂溶解后,用含有 0.1%吐温 80 的水稀释至如下所需的浓度。

[0131] 以粘虫 (*Leucania separata*)、小菜蛾 (*Plutella xylostella*) 和淡色库蚊 (*Culex pipiens pallens*) 2 龄幼虫以及桃蚜 (*Myzus persicae*) 和朱砂叶螨 (*Tetranychus cinnabarinus*) 为靶标,采用 airbrush 喷雾法和浸液法 (淡色库蚊幼虫) 进行杀虫活性测定, airbrush 喷雾处理的压力为 10psi (约合 0.7kg/cm²), 喷液量为 0.5mL。处理后 2-3 日调查靶标的死亡率。

[0132] 调查及结果统计 (所有浓度均以有效成分计)：

[0133] 药液浓度为 600mg/L 时,化合物 1 对供试靶标桃蚜死亡率达 100%。

[0134] 药液浓度为 600mg/L 时,化合物 1、4 对供试靶标朱砂叶螨死亡率达 100%。

[0135] 药液浓度为 150mg/L 时,化合物 1 对朱砂叶螨的活性 100%。

[0136] 药液浓度为 50mg/L 时,化合物 1 对朱砂叶螨的活性 100%。

[0137] 药液浓度为 10mg/L 时,化合物 1 对朱砂叶螨的活性 95%。对照药剂杀螨剂吡啶酮 (pyridaben, 江苏建湖农药厂, 原药含量 98%) 在 10mg/L 时,对朱砂叶螨的活性为 95%。