



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 106554335 A

(43) 申请公布日 2017. 04. 05

(21) 申请号 201510653910. 4

(22) 申请日 2015. 10. 10

(66) 本国优先权数据

201520768728. 9 2015. 09. 30 CN

(71) 申请人 山东省联合农药工业有限公司

地址 250100 山东省济南市历城区桑园路
28 号

(72) 发明人 唐剑峰 潘光民 刘杰 赵恭文

吴建挺 李冬蓉 牛芳

(74) 专利代理机构 山东济南齐鲁科技专利事务
所有限公司 37108

代理人 牛传凯

(51) Int. Cl.

C07D 307/33(2006. 01)

A01N 43/08(2006. 01)

A01P 5/00(2006. 01)

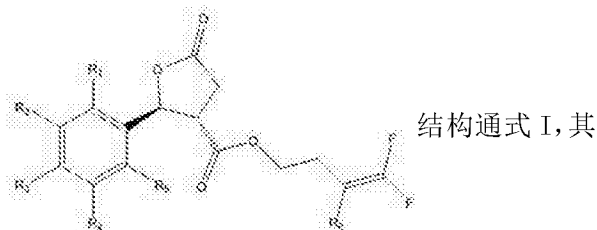
权利要求书2页 说明书20页

(54) 发明名称

一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂及其制备方法
和用途

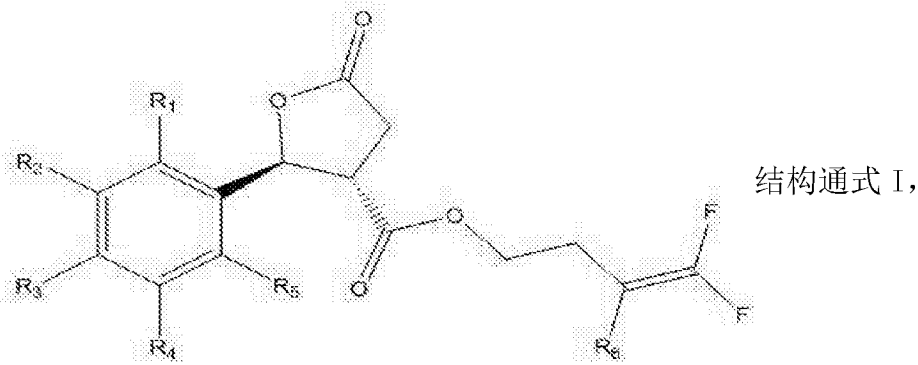
(57) 摘要

本发明公开了一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂,其特征
在于:其结构通式 I 如下所示:



中, R_1, R_2, R_3, R_4, R_5 选自氢、氧基、氟、氯、溴、含 1~4 个碳原子的烷基、含 1~4 个碳原子的烷氧基、烷氧苯基、含 1~4 个碳原子并且碳原子上氢原子被一个或多个氯原子取代的烷氧基、含 1~4 个碳原子并且碳原子上氢原子被一个或多个氟原子取代的烷氧基、硝基或胺基; R_6 选自氢、氟、氯; 本发明的反式结构的含内酯环的杀线虫剂用于防治农业线虫类病害; 本发明的反式结构的含内酯环的杀线虫剂由于含有多氟丁烯和内酯环的结构, 因而对根结线虫的卵与二龄幼虫有很好的防治效果, 尤其能很好地抑制农作物根结线虫卵的孵化; 并且毒性较低, 在农作物中的残留少提高了农业生产的安全性。

1. 一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂,其特征在於:其结构通式 I 如下所示:



其中, R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 选自氢、氰基、氟、氯、溴、含 1~4 个碳原子的烷基、含 1~4 个碳原子的烷氧基、烷氧苯基、含 1~4 个碳原子并且碳原子上氢原子被一个或多个氯原子取代的烷氧基、含 1~4 个碳原子并且碳原子上氢原子被一个或多个氟原子取代的烷氧基、硝基或胺基;

R_6 选自氢、氟、氯。

2. 根据权利要求 1 所述的反式结构的含内酯环的杀线虫剂,其特征在於: R_6 为氟原子。

3. 根据权利要求 2 所述的反式结构的含内酯环的杀线虫剂,其特征在於: $R_1=CF_3$ 时, $R_2=R_3=R_4=R_5=H$ 。

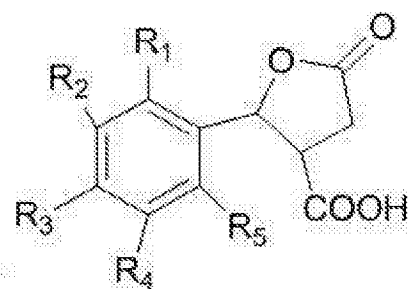
4. 根据权利要求 2 所述的反式结构的含内酯环的杀线虫剂,其特征在於: $R_1=OCF_3$ 时, $R_2=R_3=R_4=R_5=H$ 。

5. 根据权利要求 2 所述的反式结构的含内酯环的杀线虫剂,其特征在於: $R_1=R_2=R_5=H$, $R_3=F$ 时, $R_4=-O-C_6H_5$ 。

6. 根据权利要求 2 所述的反式结构的含内酯环的杀线虫剂,其特征在於: $R_2=R_4=CF_3$ 时, $R_1=R_3=R_5=H$ 。

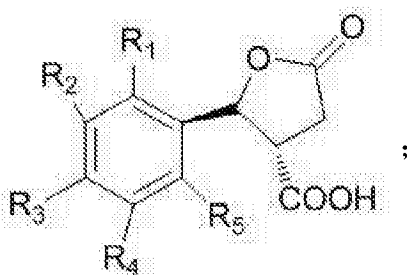
7. 权利要求 1 所述的反式结构的含内酯环的杀线虫剂的制备方法,其特征在於:包括以下步骤:

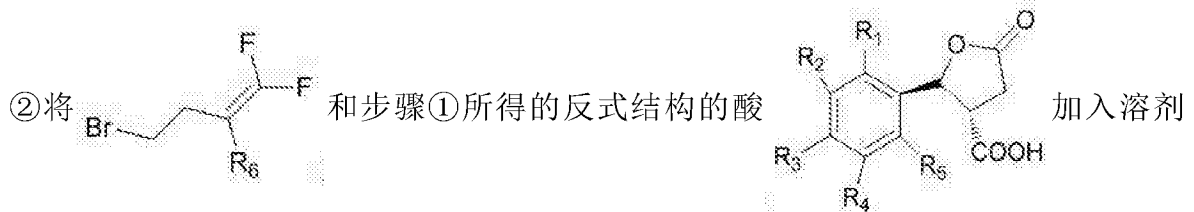
① 将具有顺反式外消旋的酸



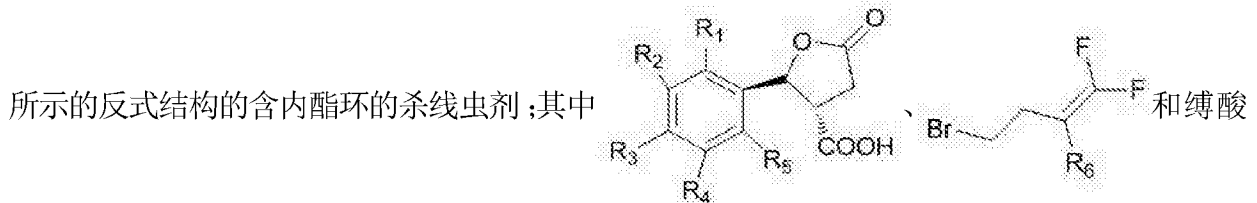
加入到体积分数为

40~70% 的硫酸溶液,50~70 °C 搅拌 3~5 小时,过滤,将滤饼加入乙酸乙酯和水中,萃取收集有机相将有机相经硫酸镁干燥,蒸掉溶剂,用甲苯重结晶,干燥得到反式结构的酸





中,加入缚酸剂,在 20~30°C 下搅拌反应 22~26 小时,在真空度 0.08~0.10kPa 下,蒸馏除去溶剂,加二氯甲烷和水搅拌均匀,静置分层除去水,在真空度 0.08~0.10kPa 下,蒸馏除去二氯甲烷得到通式 I



剂的摩尔比为 1 : 0.8~1.2 : 3~5 ;

其中, R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 选自氢、氰基、氟、氯、溴、含 1~4 个碳原子的烷基、含 1~4 个碳原子的烷氧基、烷氧苯基、含 1~4 个碳原子并且碳原子上氢原子被一个或多个氯原子取代的烷氧基、含 1~4 个碳原子并且碳原子上氢原子被一个或多个氟原子取代的烷氧基、硝基或胺基 ; R_6 选自氢、氟、氯 ;

所述的溶剂为甲醇、乙醇、丙酮或 N, N- 二甲基甲酰胺中的一种 ;

所述的缚酸剂为碳酸钾、碳酸钠、吡啶或三乙胺中的一种。

8. 权利要求 1 所述的反式结构的含内酯环的杀线虫剂的用途,其特征在于:用于防治农业线虫类病害。

一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂及其制备方法和用途

技术领域

[0001] 本发明涉及农化与医药技术领域,具体涉及一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂及其制备方法和用途。

技术背景

[0002] 线虫大多生活在土壤中,有的寄生在植物体内,通过土壤或种子传播,能破坏植物的根系,或侵入地上部分的器官,影响农作物的生长发育,并且间接传播其他微生物引起的病害,造成农业上很大的经济损失。现有的杀线虫剂是通过线虫表皮透入起毒杀作用。

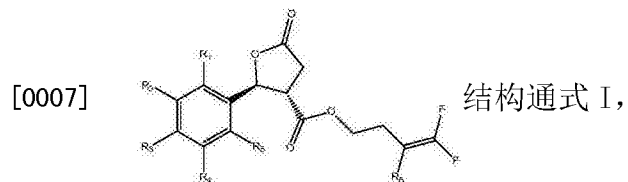
[0003] 和杀线虫剂、杀菌剂相比,目前世界上专用的效果比较好的杀线虫剂很少,仅有十余种,并且由于现有的效果较好的杀线虫剂对人畜的毒性较高,有些品种对作物有药害,影响其使用,所以新型、高效、对环境友好的杀线虫剂亟待开发。

发明内容

[0004] 本发明的目的是针对现有技术中存在的问题,提供一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂及其制备方法和用途,本发明反式结构的含内酯环的杀线虫剂对线虫有良好的杀虫活性,并且对人畜毒性小。

[0005] 本发明为实现以上目的,所采取的技术方案是:

[0006] 一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂,其结构通式 I 如下所示:



[0008] 其中, R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 选自氢、氰基、氟、氯、溴、含 1~4 个碳原子的烷基、含 1~4 个碳原子的烷氧基、烷氧苯基、含 1~4 个碳原子并且碳原子上氢原子被一个或多个氯原子取代的烷氧基、含 1~4 个碳原子并且碳原子上氢原子被一个或多个氟原子取代的烷氧基、硝基或胺基;

[0009] R_6 选自氢、氟、氯。

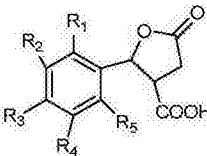
[0010] 优选的,一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂, R_6 为氟原子。

[0011] 优选的,一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂, $R_1 = CF_3$ 时, $R_2 = R_3 = R_4 = R_5 = H$ 。

[0012] 优选的,一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂, $R_1 = OCF_3$ 时, $R_2 = R_3 = R_4 = R_5 = H$ 。

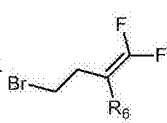
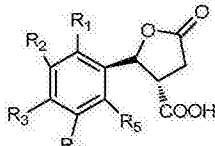
[0013] 优选的,一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂, $R_1 = R_2 = R_5 = H$, $R_3 = F$ 时, $R_4 = -O-C_6H_5$ 。

[0014] 优选的,一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂, $R_2 = R_4 = CF_3$ 时, $R_1 = R_3 = R_5 = H$ 。本发明还提供了反式结构的含内酯环的杀线虫剂的制备方法,包括以下步骤:

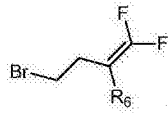
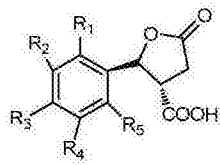
[0015] ①将具有顺反式外消旋的酸  加入到体积分数为 40 ~ 70% 的硫酸

溶液, 50 ~ 70°C 搅拌 3 ~ 5 小时, 过滤, 将滤饼加入乙酸乙酯和水中, 萃取收集有机相将有

机相经硫酸镁干燥, 蒸掉溶剂, 用甲苯重结晶, 干燥得到反式结构的酸

[0016] ②将  和步骤①所得的反式结构的酸  加入溶剂中,

加入缚酸剂, 在 20 ~ 30°C 下搅拌反应 22 ~ 26 小时, 在真空度 0.08 ~ 0.10kPa 下, 蒸馏除去溶剂, 加二氯甲烷和水搅拌均匀, 静置分层除去水, 在真空度 0.08 ~ 0.10kPa 下, 蒸馏除去二氯甲烷得到通式 I 所示的反式结构的含内酯环的杀线虫剂; 其中



和缚酸剂的摩尔比为 1 : 0.8 ~ 1.2 : 3 ~ 5 ;

[0017] 其中, R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 选自氢、氰基、氟、氯、溴、含 1 ~ 4 个碳原子的烷基、含 1 ~ 4 个碳原子的烷氧基、烷氧苯基、含 1 ~ 4 个碳原子并且碳原子上氢原子被一个或多个氯原子取代的烷氧基、含 1 ~ 4 个碳原子并且碳原子上氢原子被一个或多个氟原子取代的烷氧基、硝基或胺基; R_6 选自氢、氟、氯;

[0018] 所述的溶剂为甲醇、乙醇、丙酮或 N, N- 二甲基甲酰胺中的一种;

[0019] 所述的缚酸剂为碳酸钾、碳酸钠、吡啶或三乙胺中的一种。

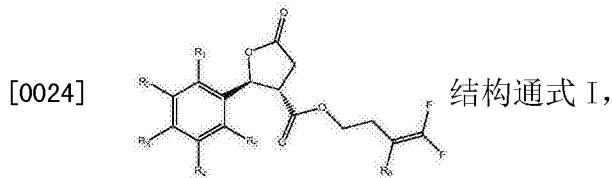
[0020] 本发明还提供了反式结构的含内酯环的杀线虫剂的用途, 用于防治农业线虫类病害。

[0021] 本发明的优点在于:

[0022] 本发明的反式结构的含内酯环的杀线虫剂由于含有多氟丁烯和内酯环的结构, 因而对根结线虫的卵与二龄幼虫有很好的防治效果, 尤其能很好地抑制黄瓜、番茄、烟草、大豆等根结线虫卵的孵化; 并且本发明的反式结构的含内酯环的杀线虫剂的毒性较低, 在农作物中的残留少, 对人、畜的危害性小, 很好解决了现有的杀线虫剂毒性较大, 在作物中的残留较多的问题, 提高了农业生产的安全性; 在较长时间内使用害虫不会对本发明的杀线虫剂产生抗体, 具有很好的杀虫效果; 本发明还提供了该反式结构的含内酯环的杀线虫剂的制备方法, 该制备方法步骤少, 工艺易于操作, 适合大规模的工业生产。

具体实施方式

[0023] 一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂, 其结构通式 I 如下所示:



[0025] 其中, R_1, R_2, R_3, R_4, R_5 选自氢、氰基、氟、氯、溴、含 1 ~ 4 个碳原子的烷基、含 1 ~ 4 个碳原子的烷氧基、烷氧苯基、含 1 ~ 4 个碳原子并且碳原子上氢原子被一个或多个氯原子取代的烷氧基、含 1 ~ 4 个碳原子并且碳原子上氢原子被一个或多个氟原子取代的烷氧基、硝基或胺基;

[0026] R_6 选自氢、氟、氯。

[0027] 优选的, 一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂, R_6 为氟原子。

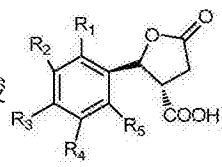
[0028] 优选的, 一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂, $R_1 = CF_3$ 时, $R_2 = R_3 = R_4 = R_5 = H$ 。

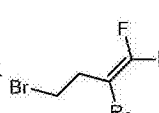
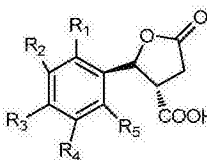
[0029] 优选的, 一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂, $R_1 = OCF_3$ 时, $R_2 = R_3 = R_4 = R_5 = H$ 。

[0030] 优选的, 一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂, $R_1 = R_2 = R_5 = H, R_3 = F$ 时, $R_4 = -O-C_6H_5$ 。

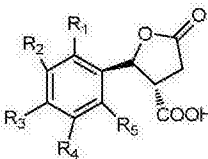
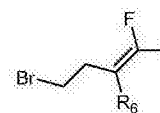
[0031] 优选的, 一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂, $R_2 = R_4 = CF_3$ 时, $R_1 = R_3 = R_5 = H$ 。本发明还提供了反式结构的含内酯环的杀线虫剂的制备方法, 包括以下步骤:

[0032] ①将具有顺反式外消旋的酸  加入到体积分数为 40 ~ 70% 的硫酸溶液, 50 ~ 70°C 搅拌 3 ~ 5 小时, 过滤, 将滤饼加入乙酸乙酯和水中, 萃取收集有机相将有

机相经硫酸镁干燥, 蒸掉溶剂, 用甲苯重结晶, 干燥得到反式结构的酸  ;

[0033] ②将  和步骤①所得的反式结构的酸  加入溶剂中,

加入缚酸剂, 在 20 ~ 30°C 下搅拌反应 22 ~ 26 小时, 在真空度 0.08 ~ 0.10kPa 下, 蒸馏除去溶剂, 加二氯甲烷和水搅拌均匀, 静置分层除去水, 在真空度 0.08 ~ 0.10kPa 下, 蒸馏除去二氯甲烷得到通式 I 所示的反式结构的含内酯环的杀线虫剂; 其中

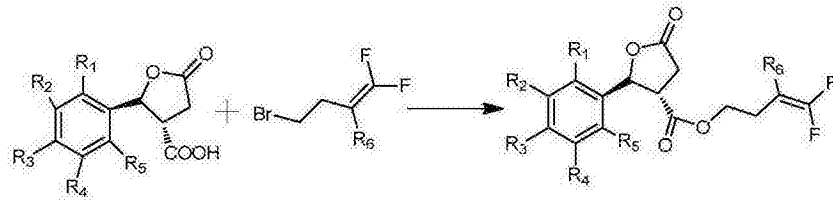
 和  和缚酸剂的摩尔比为 1 : 0.8 ~ 1.2 : 3 ~ 5 ;

[0034] 其中, R_1, R_2, R_3, R_4, R_5 选自氢、氰基、氟、氯、溴、含 1 ~ 4 个碳原子的烷基、含 1 ~ 4 个碳原子的烷氧基、烷氧苯基、含 1 ~ 4 个碳原子并且碳原子上氢原子被一个或多个氯原子

取代的烷氧基、含 1 ~ 4 个碳原子并且碳原子上氢原子被一个或多个氟原子取代的烷氧基、硝基或胺基；R₆选自氢、氟、氯；

[0035] 其反应通式为：

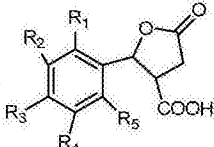
[0036]

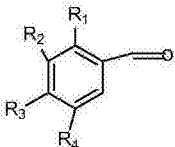
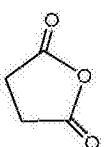


[0037] 所述的溶剂为甲醇、乙醇、丙酮或 N, N- 二甲基甲酰胺中的一种；

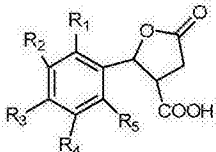
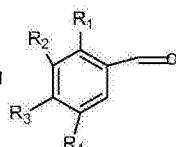
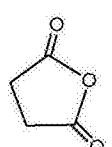
[0038] 所述的缚酸剂为碳酸钾、碳酸钠、吡啶或三乙胺中的一种。

[0039] 本发明还提供了反式结构的含内酯环的杀线虫剂的用途,用于防治农业线虫类病害。

[0040] 本发明制备方法中的原料  可在市场上购买,或采用以下步骤制

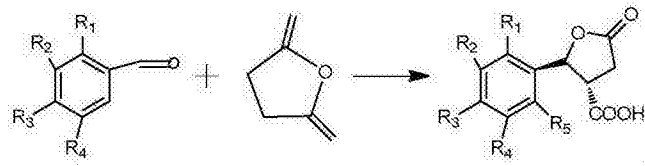
备:将  和  和无水氯化锌依次加入到二氯甲烷中,在 0 ~ 5℃下,滴加

三乙胺,滴加完毕后得到反应液,将反应液置于 20 ~ 30℃下搅拌 10 ~ 20 小时,向其中加入盐酸调节反应液的 pH 至 2,加入乙酸乙酯萃取,收集有机相,加入甲苯重结晶得到

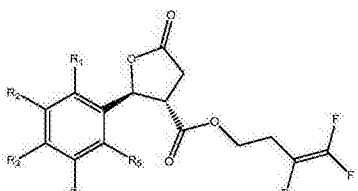
 其中  和  无水氯化锌和三乙胺的摩尔比为 1 : 0.8 ~

1.2 : 1 ~ 3 : 3 ~ 5;其反应通式为：

[0041]



[0042] 表 1 一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂的化合物的结构测量分析表

[0043]  式 I；

[0044]

序号	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆	m/z
1	H	H	H	H	H	H	m/z: 296.09 (100.0%), 297.09 (16.5%), 298.09 (2.1%)
2	CH ₃	H	H	H	H	H	m/z: 310.10 (100.0%), 311.11 (17.6%), 312.11 (2.3%)
3	H	H	CH ₃	H	H	H	m/z: 310.10 (100.0%), 311.11 (17.6%), 312.11 (2.3%)


[0045]

4	H	H	C ₂ H ₅	H	H	H	m/z: 324.12 (100.0%), 325.12 (18.7%), 326.12 (2.4%)
5	H	H	C ₃ H ₇	H	H	F	m/z: 356.12 (100.0%), 357.13 (19.8%), 358.13 (2.7%)
6	H	H	C ₄ H ₉	H	H	F	m/z: 370.14 (100.0%), 371.14 (20.7%), 372.15 (2.1%)
7	Cl	H	H	H	H	F	m/z: 348.04 (100.0%), 350.03 (32.0%), 349.04 (16.5%), 351.04 (5.3%), 350.04 (2.1%)
8	Cl	Cl	H	H	H	F	m/z: 382.00 (100.0%), 384.00 (64.7%), 383.00 (16.5%), 385.00 (10.5%), 385.99 (10.2%), 387.00 (1.8%), 386.00 (1.3%), 384.01 (1.3%)
9	Cl	H	Cl	H	H	F	m/z: 382.00 (100.0%), 384.00 (64.7%), 383.00 (16.5%), 385.00 (10.5%), 385.99 (10.2%), 387.00 (1.8%), 386.00 (1.3%), 384.01 (1.3%)
10	Cl	H	H	Cl	H	F	m/z: 382.00 (100.0%), 384.00 (64.7%), 383.00 (16.5%), 385.00 (10.5%), 385.99 (10.2%), 387.00 (1.8%), 386.00 (1.3%), 384.01 (1.3%)
11	Cl	H	H	H	Cl	F	m/z: 382.00 (100.0%), 384.00 (64.7%), 383.00 (16.5%), 385.00 (10.5%), 385.99 (10.2%), 387.00 (1.8%), 386.00 (1.3%), 384.01 (1.3%)
12	Cl	Cl	H	Cl	H	F	m/z: 415.96 (100.0%), 417.96 (96.7%), 419.95 (30.6%), 416.96 (16.4%), 418.96 (15.8%), 420.96 (5.2%), 421.95 (3.3%), 419.96 (2.0%), 417.97 (1.3%)

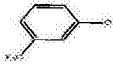
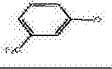
[0046]

13	H	Cl	H	Cl	H	F	m/z: 382.00 (100.0%), 384.00 (64.7%), 383.00 (16.5%), 385.00 (10.5%), 385.99 (10.2%), 387.00 (1.8%), 386.00 (1.3%), 384.01 (1.3%)
14	H	Cl	H	H	H	F	m/z: 348.04 (100.0%), 350.03 (32.0%), 349.04 (16.5%), 351.04 (5.3%), 350.04 (2.1%)
15	H	H	Cl	H	H	F	m/z: 348.04 (100.0%), 350.03 (32.0%), 349.04 (16.5%), 351.04 (5.3%), 350.04 (2.1%)
16	Cl	H	H	H	F	F	m/z: 366.03 (100.0%), 368.03 (34.0%), 367.03 (16.5%), 369.03 (5.3%)
17	H	H	Br	H	H	F	m/z: 471.90 (100.0%), 469.90 (50.9%), 473.89 (48.1%), 472.90 (16.3%), 470.90 (8.4%), 474.90 (8.1%), 473.90 (2.1%), 475.90 (1.0%)
18	H	Br	H	Br	H	F	m/z: 471.90 (100.0%), 469.90 (50.9%), 473.89 (48.1%), 472.90 (16.3%), 470.90 (8.4%), 474.90 (8.1%), 473.90 (2.1%), 475.90 (1.0%)
19	F	H	H	H	H	F	m/z: 332.07 (100.0%), 333.07 (16.5%), 334.07 (2.1%)
20	H	H	F	H	H	F	m/z: 332.07 (100.0%), 333.07 (16.5%), 334.07 (2.1%)
21	F	H	Cl	H	H	F	m/z: 366.03 (100.0%), 368.03 (34.0%), 367.03 (16.5%), 369.03 (5.3%)
22	H	F	H	Br	H	F	m/z: 409.98 (100.0%), 411.98 (99.3%), 410.98 (16.5%), 412.98 (16.1%), 413.98 (2.0%)

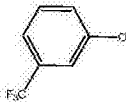



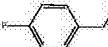
[0047]

23	H	Cl	F	H	H	F	m/z: 366.03 (100.0%), 368.03 (34.0%), 367.03 (16.5%), 369.03 (5.3%)
24	H	Cl	H	F	H	F	m/z: 366.03 (100.0%), 368.03 (34.0%), 367.03 (16.5%), 369.03 (5.3%)
25	F	H	Br	H	H	F	m/z: 409.98 (100.0%), 411.98 (99.3%), 410.98 (16.5%), 412.98 (16.1%), 413.98 (2.0%)
26	H	H	F		H	F	m/z: 442.08 (100.0%), 443.09 (23.1%), 444.09 (3.6%)
27	H	F	H	H	H	F	m/z: 332.07 (100.0%), 333.07 (16.5%), 334.07 (2.1%)
28	F	H	H	F	H	F	m/z: 350.06 (100.0%), 351.06 (16.5%), 352.06 (2.1%)
29	F	F	F	F	F	F	m/z: 404.03 (100.0%), 405.03 (16.4%), 406.04 (1.3%)
30	H	F	F	F	H	F	m/z: 368.05 (100.0%), 369.05 (16.5%), 370.06 (1.3%)
31	F	H	H	H	CF	F	m/z: 400.05 (100.0%), 401.06 (17.6%), 402.06 (2.3%)
32	F	H	CF ₃	H	H	F	m/z: 400.05 (100.0%), 401.06 (17.6%), 402.06 (2.3%)
33	H	F	OCH ₃	F	H	F	m/z: 380.07 (100.0%), 381.07 (17.6%), 382.08 (1.5%), 382.07 (1.0%)
34	OCH ₃	H	H	H	H	H	m/z: 326.10 (100.0%), 327.10 (17.7%), 328.10 (2.5%)
35	OCH ₃	H	H	H	H	F	m/z: 344.09 (100.0%), 345.09 (17.7%), 346.09 (2.5%)
36	H	OCH ₃	H	H	H	H	m/z: 326.10 (100.0%), 327.10 (17.7%), 328.10 (2.5%)

[0048]

37	H	OCH ₃	H	H	H	F	m/z: 344.09 (100.0%), 345.09 (17.7%), 346.09 (2.5%)
38	H	H	OCH ₃	H	H	H	m/z: 326.10 (100.0%), 327.10 (17.7%), 328.10 (2.5%)
39	H	H	OCH ₃	H	H	F	m/z: 344.09 (100.0%), 345.09 (17.7%), 346.09 (2.5%)
40	OCF ₃	H	H	H	H	H	m/z: 380.07 (100.0%), 381.07 (17.6%), 382.08 (1.5%), 382.07 (1.0%)
41	OCF ₃	H	H	H	H	F	m/z: 398.06 (100.0%), 399.06 (17.5%), 400.07 (1.5%), 400.06 (1.0%)
42	CF ₃	H	OCH ₃	H	H	F	m/z: 412.07 (100.0%), 413.08 (18.7%), 414.08 (2.7%)
43	OCH ₂ CH ₃	H	H	H	H	F	m/z: 358.10 (100.0%), 359.11 (18.8%), 360.11 (2.7%)
44	H	H	OC(CH ₂) ₂ CH ₃	H	H	F	m/z: 358.10 (100.0%), 359.11 (18.8%), 360.11 (2.7%)
45	CF ₃	H	H	H	H	H	m/z: 364.07 (100.0%), 365.08 (17.6%), 366.08 (2.3%)
46	CF ₃	H	H	H	H	F	m/z: 382.06 (100.0%), 383.07 (17.6%), 384.07 (2.3%)
47	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H	m/z: 432.06 (100.0%), 433.06 (18.4%), 434.07 (2.5%)
48	H	CF ₃	H	CF ₃	H	F	m/z: 450.05 (100.0%), 451.05 (18.4%), 452.06 (2.5%)
49	H	H	CN	H	H	F	m/z: 339.07 (100.0%), 340.08 (17.6%), 341.08 (2.3%)
50	H		H	H	H	F	m/z: 406.10 (100.0%), 407.11 (23.1%), 408.11 (3.6%)
51	H	H		H	H	F	m/z: 406.10 (100.0%), 407.11 (23.1%), 408.11 (3.6%)

[0049]

							408.11 (3.6%)	
52	H		H	H	H	F	m/z: 474.09 (100.0%), 475.09 (24.0%), 476.10 (2.8%), 476.09 (1.0%)	
53			H	H	H	H	F	m/z: 420.12 (100.0%), 421.12 (24.2%), 422.13 (2.8%), 422.12 (1.0%)
54	H	H		H	H	F	m/z: 440.06 (100.0%), 442.06 (32.0%), 441.07 (23.1%), 443.06 (7.3%), 442.07 (3.6%), 444.07 (1.2%)	
55	H	H		H	H	F	m/z: 424.09 (100.0%), 425.10 (23.1%), 426.10 (3.6%)	
56	H	H		H	H	F	m/z: 438.11 (100.0%), 439.11 (24.0%), 440.12 (2.8%), 440.11 (1.0%)	
57	H	NO ₂	H	H	H	F	m/z: 359.06 (100.0%), 360.07 (16.6%), 361.07 (2.5%)	
58	H	H	NO ₂	H	H	F	m/z: 359.06 (100.0%), 360.07 (16.6%), 361.07 (2.5%)	
59	NH ₂	H	H	H	H	F	m/z: 329.09 (100.0%), 330.09 (16.5%), 331.09 (2.1%)	
60	H	H	NH ₂	H	H	F	m/z: 329.09 (100.0%), 330.09 (16.5%), 331.09 (2.1%)	

[0050] 本发明的一种反式结构的含内酯环的杀线虫剂均可按照本发明的制备方法得到，下面为表 1 中化合物的具体实施例：

[0051] 实施例 1

[0052] 制备表 1 中序号 2 的化合物包括下述步骤：

[0053] ①将 1mol 邻甲基苯甲醛、0.8mol 琥珀酐和 1mol 无水氯化锌加入 300ml 二氯甲烷中，在 0℃下滴加 3mol 三乙胺，滴加完毕得到反应液，将反应液置于 20℃下搅拌 10h，向其中加入盐酸调节反应液的 pH 至 2，加入 200ml 乙酸乙酯萃取，收集有机相，向有机相中加入 200ml 甲苯重结晶得到 5-氧代-2-(2-甲基苯基)四氢呋喃-3-羧酸；

[0054] ②将步骤①所得 5-氧代-2-(2-甲基苯基)四氢呋喃-3-羧酸加入 40%的硫酸溶液中，50℃搅拌 3h，过滤，将滤饼加入乙酸乙酯和水中，萃取收集有机相将有机相经硫酸镁干燥，蒸掉溶剂，剩余的有机物用甲苯重结晶，干燥得到反式结构的 5-氧代-2-(2-甲基苯

基) 四氢呋喃-3-羧酸。

[0055] ③将步骤②所得 0.5mol 反式结构的 5-氧代-2-(2-甲基苯基) 四氢呋喃-3-羧酸和 0.4mol 4-溴-1,1-二氟-1-丁烯加入 500ml 甲醇中,加入 1.5mol 碳酸钾,在 20℃下搅拌反应 22 小时,在真空度 0.08kPa 下,蒸馏除去甲醇,将剩余物加入 100ml 二氯甲烷和 50ml 水搅拌均匀,静置分层,收集二氯甲烷相,将收集的二氯甲烷相在真空度 0.08kPa 下蒸馏除去二氯甲烷得到产品,即表 1 中序号 2 的化合物。

[0056] 元素分析结果 :C,61.93 ;H,5.20 ;F,12.25 ;O,20.62。

[0057] 核磁分析结果 : δ 2.24, 2H ; δ 2.34, 3H ; δ 2.52-2.77, 2H ; δ 3.31, 1H ; δ 4.12, 2H ; δ 4.28, 1H ; δ 6.21, 1H ; δ 7.19-7.26, 3H ; δ 7.39, 1H。

[0058] 实施例 2

[0059] 制备表 1 中序号 26 的化合物包括下述步骤 :

[0060] ①将 1mol 4-氟-5-苯氧基苯甲醛、1.2mol 琥珀酐和 3mol 无水氯化锌加入 400ml 二氯甲烷中,在 5℃下滴加 5mol 三乙胺,滴加完毕得到反应液,将反应液置于 30℃下搅拌 20h,向其中加入盐酸调节反应液的 pH 至 2,加入 250ml 乙酸乙酯萃取,收集有机相,向有机相中加入 250ml 甲苯重结晶得到 5-氧代-2-(2-(4-氟-5-苯氧基) 苯基) 四氢呋喃-3-羧酸 ;

[0061] ②将步骤①所得 5-氧代-2-(2-(4-氟-5-苯氧基) 苯基) 四氢呋喃-3-羧酸加入 70% 的硫酸溶液中,40℃搅拌 5h,过滤,将滤饼加入乙酸乙酯和水中,萃取收集有机相将有机相经硫酸镁干燥,蒸掉溶剂,剩余的有机物用甲苯重结晶,干燥得到反式结构的 5-氧代-2-(2-(4-氟-5-苯氧基) 苯基) 四氢呋喃-3-羧酸。

[0062] ③将步骤②所得 0.5mol 反式结构的 5-氧代-2-(2-(4-氟-5-苯氧基) 苯基) 四氢呋喃-3-羧酸和 0.6mol 4-溴-1,1-二氟-1-丁烯加入 400ml 乙醇中,加入 2.5mol 碳酸钠,在 30℃下搅拌反应 26 小时,在真空度 0.10kPa 下,蒸馏除去乙醇,将剩余物加入 120ml 二氯甲烷和 80ml 水搅拌均匀,静置分层,收集二氯甲烷相,将收集的二氯甲烷相在真空度 0.12kPa 下蒸馏除去二氯甲烷得到产品,即表 1 中序号 26 的化合物。

[0063] 元素分析结果 :C,59.44 ;H,3.80 ;F,17.91 ;O,18.85。

[0064] 核磁分析结果 : δ 2.24, 2H ; δ 2.52-2.77, 2H ; δ 3.31, 1H ; δ 4.12, 2H ; δ 6.21, 1H ; δ 7.06-7.14, 5H ; δ 7.27, 1H ; δ 7.41, 2H。

[0065] 实施例 3

[0066] 制备表 1 中序号 41 的化合物包括下述步骤 :

[0067] ①将 1mol 邻三氟甲基苯甲醛、1mol 琥珀酐和 2mol 无水氯化锌加入 300ml 二氯甲烷中,在 5℃下滴加 4mol 三乙胺,滴加完毕得到反应液,将反应液置于 25℃下搅拌 15h,向其中加入盐酸调节反应液的 pH 至 2,加入 220ml 乙酸乙酯萃取,收集有机相,向有机相中加入 220ml 甲苯重结晶得到 5-氧代-2-(2-(三氟甲氧基) 苯基) 四氢呋喃-3-羧酸 ;

[0068] ②将步骤①所得 5-氧代-2-(2-(三氟甲氧基) 苯基) 四氢呋喃-3-羧酸加入 50% 的硫酸溶液中,70℃搅拌 5h,过滤,将滤饼加入乙酸乙酯和水中,萃取收集有机相将有机相经硫酸镁干燥,蒸掉溶剂,剩余的有机物用甲苯重结晶,干燥得到反式结构的 5-氧代-2-(2-(三氟甲氧基) 苯基) 四氢呋喃-3-羧酸。

[0069] ③将步骤②所得 0.5mol 反式结构的 5-氧代-2-(2-(三氟甲氧基) 苯基) 四氢

呋喃-3-羧酸和 0.5mol 4-溴-1,1,2-三氟-1-丁烯加入 380ml 丙酮中,加入 2.0mol 吡啶,在 25℃下搅拌反应 24 小时,在真空度 0.10kPa 下,蒸馏除去丙酮,将剩余物加入 120ml 二氯甲烷和 100ml 水搅拌均匀,静置分层,收集二氯甲烷相,将收集的二氯甲烷相在真空度 0.10kPa 下蒸馏除去二氯甲烷得到产品,即表 1 中序号 41 的化合物。

[0070] 元素分析结果 :C, 48.25 ;H, 3.04 ;F, 28.62 ;O, 20.09。

[0071] 核磁分析结果 : δ 2.24, 2H ; δ 2.52-2.77, 2H ; δ 3.31, 1H ; δ 4.12, 2H ; δ 6.21, 1H ; δ 6.92-6.96, 3H ; δ 7.25, 1H。

[0072] 实施例 4

[0073] 制备表 1 中序号 46 的化合物包括下述步骤 :

[0074] ①将 1mol 邻三氟甲基苯甲醛、1.1mol 琥珀酐和 2.5mol 无水氯化锌加入 300ml 二氯甲烷中,在 3℃下滴加 3.5mol 三乙胺,滴加完毕得到反应液,将反应液置于 22℃下搅拌 12h,向其中加入盐酸调节反应液的 pH 至 2,加入 250ml 乙酸乙酯萃取,收集有机相,向有机相中加入 250ml 甲苯重结晶得到 5-氧代-2-(2-(三氟甲基)苯基)四氢呋喃-3-羧酸 ;

[0075] ②将步骤①所得 5-氧代-2-(2-(三氟甲基)苯基)四氢呋喃-3-羧酸加入 40% 的硫酸溶液中,70℃搅拌 4h,过滤,将滤饼加入乙酸乙酯和水中,萃取收集有机相将有机相经硫酸镁干燥,蒸掉溶剂,剩余的有机物用甲苯重结晶,干燥得到反式结构的 5-氧代-2-(2-(三氟甲基)苯基)四氢呋喃-3-羧酸。

[0076] ③将步骤②所得 0.5mol 反式结构的 5-氧代-2-(2-(三氟甲基)苯基)四氢呋喃-3-羧酸和 0.5mol 4-溴-1,1,2-三氟-1-丁烯加入 380ml 丙酮中,加入 2.0mol 三乙胺,在 25℃下搅拌反应 22 小时,在真空度 0.10kPa 下,蒸馏除去丙酮,将剩余物加入 120ml 二氯甲烷和 100ml 水搅拌均匀,静置分层,收集二氯甲烷相,将收集的二氯甲烷相在真空度 0.10kPa 下蒸馏除去二氯甲烷得到产品,即表 1 中序号 46 的化合物。

[0077] 元素分析结果 :C, 50.28 ;H, 3.16 ;F, 29.82 ;O, 16.73。

[0078] 核磁分析结果 : δ 2.24, 2H ; δ 2.52-2.77, 2H ; δ 3.31, 1H ; δ 4.12, 2H ; δ 6.21, 1H ; δ 7.29-7.38, 3H ; δ 7.55, 1H。

[0079] 实施例 5

[0080] 制备表 1 中序号 48 的化合物包括下述步骤 :

[0081] ①将 1mol 3,5-双三氟甲基苯甲醛、0.9mol 琥珀酐和 2.5mol 无水氯化锌加入 300ml 二氯甲烷中,在 4℃下滴加 3.5mol 三乙胺,滴加完毕得到反应液,将反应液置于 22℃下搅拌 16h,向其中加入盐酸调节反应液的 pH 至 2,加入 250ml 乙酸乙酯萃取,收集有机相,向有机相中加入 250ml 甲苯重结晶得到 5-氧代-2-(2-(3,5-双三氟甲基)苯基)四氢呋喃-3-羧酸 ;

[0082] ②将步骤①所得 5-氧代-2-(2-(3,5-双三氟甲基)苯基)四氢呋喃-3-羧酸加入 70% 的硫酸溶液中,70℃搅拌 5h,过滤,将滤饼加入乙酸乙酯和水中,萃取收集有机相将有机相经硫酸镁干燥,蒸掉溶剂,剩余的有机物用甲苯重结晶,干燥得到反式结构的 5-氧代-2-(2-(3,5-双三氟甲基)苯基)四氢呋喃-3-羧酸。

[0083] ③将步骤②所得 0.5mol 反式结构的 5-氧代-2-(2-(3,5-双三氟甲基)苯基)四氢呋喃-3-羧酸和 0.5mol 4-溴-1,1,2-三氟-1-丁烯加入 380ml 丙酮中,加入 2.0mol 三乙胺,在 25℃下搅拌反应 22 小时,在真空度 0.10kPa 下,蒸馏除去丙酮,将剩余物加入 120ml

二氯甲烷和 100ml 水搅拌均匀,静置分层,收集二氯甲烷相,将收集的二氯甲烷相在真空度 0.10kPa 下蒸馏除去二氯甲烷得到产品,即表 1 中序号 48 的化合物。

[0084] 元素分析结果 :C, 45.35 ;H, 2.46 ;F, 37.98 ;O, 14.21。

[0085] 核磁分析结果 : δ 2.24, 2H ; δ 2.52-2.77, 2H ; δ 3.31, 1H ; δ 4.12, 2H ; δ 6.21, 1H ; δ 7.62, 2H ; δ 7.94, 1H。

[0086] 杀线虫试验

[0087] 对表 1 中的化合物采用浸虫法进行了抑制植物病原线虫试验,以测定以上化合物对二龄幼虫的活性,同时参照 NY/T 1154.5-2006(第 5 部分:杀卵活性试验浸渍法)测试以上化合物对线虫卵孵化的抑制活性,结果如表 2 所示:

[0088] 表 2 含反式内酯环的杀线虫剂的化合物抑制植物病原线虫试验结果

[0089]

药剂	试材	回归方程	LC ₅₀ (μg/ml)	相关系数 (R ²)	95%置信区间
化合物 1	线虫卵	$y=-1.713+1.332x$	6.91	0.991	8.378~11.456
	线虫 J ₂	$y=-1.425+1.412x$	8.23	0.992	7.256~13.532
化合物 2	线虫卵	$y=-1.298+1.700x$	5.80	0.990	4.927~6.883
	线虫 J ₂	$y=-1.411+1.651x$	7.16	0.987	6.022~8.465
化合物 3	线虫卵	$y=-1.515+1.012x$	7.52	0.984	9.343~11.846
	线虫 J ₂	$y=-1.258+1.427x$	8.56	0.992	6.245~11.267
化合物 4	线虫卵	$y=-1.144+1.245x$	8.74	0.979	7.544~10.425
	线虫 J ₂	$y=-1.727+1.534x$	9.04	0.990	6.756~11.554
化合物 5	线虫卵	$y=-2.909+3.248x$	7.862	0.905	6.048~10.624
	线虫 J ₂	$y=-3.549+3.633x$	9.482	0.974	8.770~10.422
化合物 6	线虫卵	$y=-1.224+1.145x$	7.89	0.985	8.365~11.463
	线虫 J ₂	$y=-1.327+1.024x$	8.45	0.994	8.279~14.182
化合物 7	线虫卵	$y=-1.153+1.445x$	8.81	0.989	9.344~11.438
	线虫 J ₂	$y=-1.244+1.274x$	9.75	0.992	11.251~18.472
化合物 8	线虫卵	$y=-1.037+1.146x$	8.81	0.991	8.332~12.454
	线虫 J ₂	$y=-1.112+1.578x$	9.14	0.985	11.459~15.105

[0090]

化合物 9	线虫卵	$y=-1.324+1.208x$	7.36	0.994	8.124~12.423
	线虫 J ₂	$y=-1.216+1.227x$	9.14	0.991	6.254~13.124
化合物 10	线虫卵	$y=-1.187+1.149x$	10.80	0.987	8.551~13.751
	线虫 J ₂	$y=-1.325+1.179x$	13.30	0.988	10.620~17.149
化合物 11	线虫卵	$y=-1.550+1.739x$	7.78	0.997	6.610~9.148
	线虫 J ₂	$y=-1.454+1.578x$	8.35	0.997	7.006~9.977
化合物 12	线虫卵	$y=-1.259+1.144x$	7.30	0.992	12.597~15.142
	线虫 J ₂	$y=-2.016+1.174x$	8.35	0.993	10.934~17.623
化合物 13	线虫卵	$y=-1.059+1.512x$	4.99	0.991	9.225~14.556
	线虫 J ₂	$y=-2.365+1.685x$	6.28	0.984	12.144~17.142
化合物 14	线虫卵	$y=-1.812+1.244x$	7.18	0.987	12.047~17.542
	线虫 J ₂	$y=-2.135+1.612x$	8.45	0.989	14.971~18.142
化合物 15	线虫卵	$y=-1.371+1.348x$	10.39	0.996	8.491~12.759
	线虫 J ₂	$y=-1.768+1.501x$	15.07	0.915	8.674~36.085
化合物 16	线虫卵	$y=-1.205+1.274x$	7.91	0.985	10.860~16.128
	线虫 J ₂	$y=-1.247+1.718x$	9.25	0.990	7.699~12.194
化合物 17	线虫卵	$y=-1.272+1.633x$	9.12	0.994	6.420~10.248
	线虫 J ₂	$y=-1.244+1.312x$	10.85	0.992	6.623~9.867
化合物 18	线虫卵	$y=-1.569+1.178x$	8.25	0.991	7.818~10.514
	线虫 J ₂	$y=-1.412+1.442x$	9.47	0.989	6.628~10.194
化合物 19	线虫卵	$y=-1.114+1.145x$	7.21	0.985	6.827~10.543
	线虫 J ₂	$y=-1.187+1.709x$	9.25	0.992	8.699~12.194
化合物 20	线虫卵	$y=-1.156+1.281x$	7.993	0.996	6.456~10.297
	线虫 J ₂	$y=-1.248+1.276x$	9.515	0.993	7.613~12.581
化合物 21	线虫卵	$y=-1.509+1.214x$	8.18	0.989	8.464~12.524
	线虫 J ₂	$y=-1.624+1.138x$	9.74	0.990	7.625~10.438
化合物 22	线虫卵	$y=-1.456+1.127x$	7.57	0.989	10.860~14.545
	线虫 J ₂	$y=-1.212+1.134x$	9.25	0.992	7.614~10.145
化合物 23	线虫卵	$y=-1.386+1.124x$	7.23	0.989	6.140~10.246

[0091]

	线虫 J ₂	$y=-1.127+1.248x$	9.44	0.992	7.613~9.167
化合物 24	线虫卵	$y=-1.212+1.285x$	7.21	0.987	6.807~9.156
	线虫 J ₂	$y=-1.123+1.545x$	9.24	0.992	8.614~11.124
化合物 25	线虫卵	$y=-1.566+1.485x$	5.91	0.991	8.412~10.524
	线虫 J ₂	$y=-1.457+1.586x$	6.74	0.987	9.624~13.190
化合物 26	线虫卵	$y=-1.576+1.415x$	9.01	0.997	8.786~11.141
	线虫 J ₂	$y=-1.243+1.118x$	11.23	0.995	8.612~11.156
化合物 27	线虫卵	$y=-1.040+1.572x$	4.59	0.994	3.836~5.472
	线虫 J ₂	$y=-1.283+1.538x$	6.82	0.997	5.705~8.297
化合物 28	线虫卵	$y=-1.122+1.853x$	6.25	0.990	12.142~15.124
	线虫 J ₂	$y=-1.242+1.457x$	7.34	0.990	11.524~15.247
化合物 29	线虫卵	$y=-1.761+1.238x$	8.24	0.985	9.555~13.125
	线虫 J ₂	$y=-1.318+1.257x$	9.34	0.992	10.598~15.245
化合物 30	线虫卵	$y=-1.334+1.157x$	7.56	0.994	11.145~17.103
	线虫 J ₂	$y=-1.084+1.127x$	8.89	0.992	11.524~16.431
化合物 31	线虫卵	$y=-1.896+1.716x$	12.74	0.963	8.840~19.527
	线虫 J ₂	$y=-1.215+1.027x$	15.25	0.994	11.780~20.883
化合物 32	线虫卵	$y=-1.258+1.562x$	7.84	0.989	11.170~15.353
	线虫 J ₂	$y=-1.145+1.375x$	8.56	0.991	13.047~16.312
化合物 33	线虫卵	$y=-1.546+1.227x$	6.08	0.989	10.190~15.243
	线虫 J ₂	$y=-1.212+1.258x$	7.34	0.991	11.347~17.126
化合物 34	线虫卵	$y=-1.214+1.572x$	6.22	0.985	10.124~16.183
	线虫 J ₂	$y=-1.465+1.328x$	8.15	0.991	11.381~18.224
化合物 35	线虫卵	$y=-1.184+1.356x$	4.64	0.985	10.141~15.224
	线虫 J ₂	$y=-1.485+1.234x$	6.07	0.991	10.547~15.136
化合物 36	线虫卵	$y=-1.114+1.284x$	6.54	0.992	10.162~18.243
	线虫 J ₂	$y=-1.346+1.228x$	7.36	0.996	10.027~16.314
化合物 37	线虫卵	$y=-1.378+1.471x$	8.64	0.982	7.124~10.403
	线虫 J ₂	$y=-1.168+1.090x$	11.78	0.996	9.244~15.311

[0092]

化合物 38	线虫卵	$y=-1.127+1.142x$	7.12	0.992	9.224~13.436
	线虫 J ₂	$y=-1.127+1.049x$	8.26	0.994	8.756~13.263
化合物 39	线虫卵	$y=-1.191+1.602x$	8.75	0.991	8.245~13.528
	线虫 J ₂	$y=-1.432+1.879x$	9.84	0.997	9.726~14.245
化合物 40	线虫卵	$y=-1.124+1.232x$	5.56	0.990	9.245~15.014
	线虫 J ₂	$y=-1.456+1.714x$	6.89	0.994	8.726~13.245
化合物 41	线虫卵	$y=-1.423+1.122x$	6.35	0.992	10.299~14.181
	线虫 J ₂	$y=-1.256+1.413x$	8.86	0.989	9.726~13.245
化合物 42	线虫卵	$y=-1.728+1.614x$	7.49	0.991	9.214~15.735
	线虫 J ₂	$y=-1.873+1.708x$	8.45	0.992	8.726~13.248
化合物 43	线虫卵	$y=-1.253+1.376x$	7.98	0.991	8.152~13.126
	线虫 J ₂	$y=-1.345+1.191x$	9.35	0.994	13.248~18.242
化合物 44	线虫卵	$y=-1.114+1.286x$	5.23	0.990	8.152~14.422
	线虫 J ₂	$y=-1.354+1.112x$	7.12	0.994	11.124~18.216
化合物 45	线虫卵	$y=-1.452+1.237x$	6.54	0.986	8.152~14.248
	线虫 J ₂	$y=-1.276+1.224x$	8.31	0.989	12.428~18.126
化合物 46	线虫卵	$y=-1.214+1.218x$	4.98	0.991	7.152~13.638
	线虫 J ₂	$y=-1.326+1.171x$	6.24	0.989	9.157~15.146
化合物 47	线虫卵	$y=-1.126+1.458x$	5.41	0.990	7.232~12.358
	线虫 J ₂	$y=-1.256+1.636x$	7.24	0.992	12.158~16.386
化合物 48	线虫卵	$y=-1.314+1.737x$	6.28	0.986	7.422~13.147
	线虫 J ₂	$y=-1.352+1.374x$	7.56	0.991	12.878~18.132
化合物 49	线虫卵	$y=-1.127+1.292x$	5.67	0.989	9.152~14.398
	线虫 J ₂	$y=-1.355+1.784x$	6.89	0.987	13.378~19.212
化合物 50	线虫卵	$y=-1.051+1.343x$	8.56	0.991	8.562~13.129
	线虫 J ₂	$y=-1.126+1.844x$	9.45	0.995	13.158~18.643
化合物 51	线虫卵	$y=-1.273+1.206x$	7.12	0.995	8.152~14.348
	线虫 J ₂	$y=-1.185+1.125x$	8.54	0.992	12.458~18.126
化合物 52	线虫卵	$y=-1.875+1.213x$	6.45	0.992	8.152~12.346

[0093]

	线虫 J ₂	$y=-1.375+1.128x$	7.28	0.996	11.246~17.646
化合物 53	线虫卵	$y=-1.276+1.439x$	7.69	0.982	6.269~9.288
	线虫 J ₂	$y=-1.300+1.391x$	8.61	0.986	7.021~10.463
化合物 54	线虫卵	$y=-1.114+1.238x$	8.40	0.975	7.650~13.245
	线虫 J ₂	$y=-1.514+1.527x$	9.16	0.989	9.356~13.023
化合物 55	线虫卵	$y=-1.123+1.274x$	9.24	0.987	6.456~10.456
	线虫 J ₂	$y=-1.122+1.574x$	10.36	0.984	8.966~13.526
化合物 56	线虫卵	$y=-1.112+1.241x$	8.34	0.989	6.456~11.235
	线虫 J ₂	$y=-1.264+1.212x$	9.78	0.992	8.406~14.043
化合物 57	线虫卵	$y=-1.134+1.228x$	9.42	0.990	7.654~11.447
	线虫 J ₂	$y=-1.512+1.035x$	10.23	0.996	6.656~11.476
化合物 58	线虫卵	$y=-1.145+1.176x$	6.12	0.989	6.056~10.415
	线虫 J ₂	$y=-1.227+1.112x$	7.45	0.987	6.412~11.464
化合物 59	线虫卵	$y=-1.273+1.214x$	7.13	0.992	6.623~13.426
	线虫 J ₂	$y=-1.273+1.205x$	8.44	0.995	7.426~14.023
化合物 60	线虫卵	$y=-1.141+1.309x$	7.44	0.98	6.046~9.448
	线虫 J ₂	$y=-1.486+1.562x$	8.94	0.99	7.457~10.664

[0094] 由表 1 中的数据可知,本发明反式结构的含内酯环的杀线虫剂的化合物对线虫二龄幼虫及卵均有很好的防治效果,并且对线虫卵的孵化抑制率要比对二龄幼虫的效果好。

[0095] 毒性试验

[0096] 根据化学农药环境安全评价试验准则中的蚯蚓毒性试验和土壤微生物毒性试验的步骤对本发明表 1 中的化合物 1 ~ 60 进行蚯蚓毒性试验和土壤微生物毒性试验,其中土壤微生物试验中模拟的农药常用量为 40ppm,两个试验的结果如下:

[0097] 表 2 反式内酯环的杀线虫剂的化合物的毒性实验结果

[0098]

	蚯蚓毒性 LC50 (14 d) (单位: mg/L)	土壤微生物毒性 (15d) (加量为常量 100 倍时的抑制率)
--	--------------------------------	-------------------------------------

[0099]

化合物 1	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 2	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 3	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 4	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 5	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 6	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 7	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 8	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 9	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 10	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 11	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 12	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 13	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 14	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 15	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 16	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 17	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 18	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 19	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 20	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 21	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 22	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 23	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 24	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 25	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 26	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 27	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 28	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 29	>10, 低毒	低于 50%, 低毒

[0100]

化合物 30	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 31	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 32	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 33	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 34	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 35	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 36	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 37	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 38	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 39	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 40	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 41	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 42	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 43	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 44	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 45	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 46	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 47	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 48	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 49	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 50	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 51	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 52	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 53	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 54	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 55	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 56	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 57	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 58	>10, 低毒	低于 50%, 低毒

[0101]

化合物 59	>10, 低毒	低于 50%, 低毒
化合物 60	>10, 低毒	低于 50%, 低毒

[0102] 由表 2 中的数据可知, 该本发明反式结构含内酯环的杀线虫剂的化合物对土壤环境中的生物的毒性低, 使用安全, 属于环境友好型化合物。