



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 101263118 B

(45) 授权公告日 2015. 08. 12

(21) 申请号 200680033149. 3

(22) 申请日 2006. 09. 12

(30) 优先权数据

05356156. 9 2005. 09. 13 EP

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2008. 03. 10

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/EP2006/066290 2006. 09. 12

(87) PCT国际申请的公布数据

W02007/031523 EN 2007. 03. 22

(73) 专利权人 拜耳农科股份公司

地址 德国莱因河畔蒙海姆

(72) 发明人 P·鲁曼 K·孔茨 J·格罗伊尔

O·古斯 B·哈特曼 K·依格

W·莫蒂 T·舍茨 J·-P·沃尔斯

P·达曼 A·沃斯特

U·沃彻多夫-纽曼 M·德威斯

R·邓肯 R·艾伯瑞特 P·洛塞尔

O·马尔萨姆

(74) 专利代理机构 上海专利商标事务所有限公

司 31100

代理人 白益华

(51) Int. Cl.

C07D 213/64(2006. 01)

C07D 213/84(2006. 01)

A01N 43/40(2006. 01)

(56) 对比文件

JP 特开昭 63-250371 A, 1988. 10. 18,

CN 1342137 A, 2002. 03. 27,

US 5064846 A, 1991. 11. 12,

EP 1178039 A1, 2002. 02. 06,

US 3898277 A, 1975. 08. 05,

EP 1179528 A2, 2002. 02. 13,

EP 1570736 A1, 2005. 09. 07,

EP 1178038 A1, 2002. 02. 06,

John W. Liebeschuetz, et al.. Rationally

Designed Guanidine and Amidine Fungicides.

Pesticide Science. 1999, 50(3), 258-274.

审查员 于治萍

权利要求书4页 说明书24页

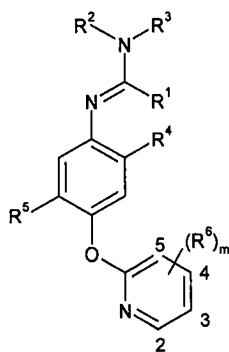
(54) 发明名称

具有杀真菌活性的吡啶氧基取代的苯脒衍生物

(57) 摘要

本发明涉及取代基如文中所述的通式 (I) 的 2,5-二取代的-4-吡啶氧基-取代的-苯基-脒衍生物,特别是 2,5-二烷基-4-吡啶氧基-取代的-苯基-脒衍生物,以及它们的制备方法和它们作为杀真菌活性剂(特别是以杀真菌组合物的形式的杀真菌活性剂)的用途,以及使用这些化合物或组合物(I)控制植物病原真菌(特别是植物的植物病原真菌)的方法。

1. 一种下式的苯脒衍生物：



式中：

R^1 表示 H；

R^2 表示甲基；

R^3 表示乙基；

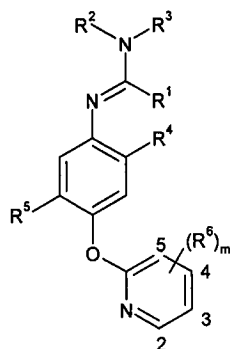
R^4 表示甲基；

R^5 表示甲基；

m 表示 2；

R^6 表示 2- 乙基、4- 氯。

2. 一种下式的苯脒衍生物：



式中：

R^1 表示 H；

R^2 和 R^3 一起形成 $-(CH_2)_5-$ ；

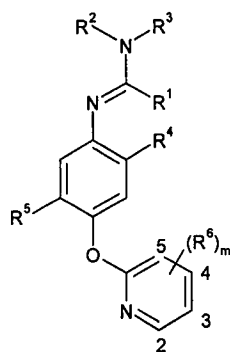
R^4 表示甲基；

R^5 表示甲基；

m 表示 2；

R^6 表示 3- 甲基、2- 氯。

3. 一种下式的苯脒衍生物：



式中：

R^1 表示 H；

R^2 表示甲基；

R^3 表示正丙基；

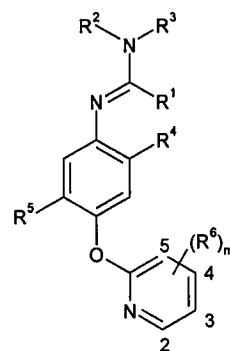
R^4 表示甲基；

R^5 表示甲基；

m 表示 2；

R^6 表示 2- 异丙基、4- 氯。

4. 一种下式的苯咪唑衍生物：



式中：

R^1 表示 H；

R^2 和 R^3 一起形成 $-(CH_2)_4-$ ；

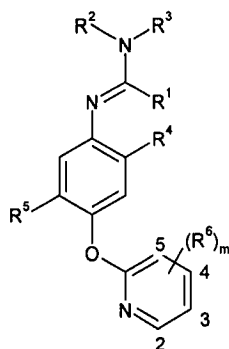
R^4 表示甲基；

R^5 表示甲基；

m 表示 2；

R^6 表示 2- 异丙基、4- 氯。

5. 一种下式的苯咪唑衍生物：



式中：

R^1 表示H；

R^2 表示甲基；

R^3 表示乙基；

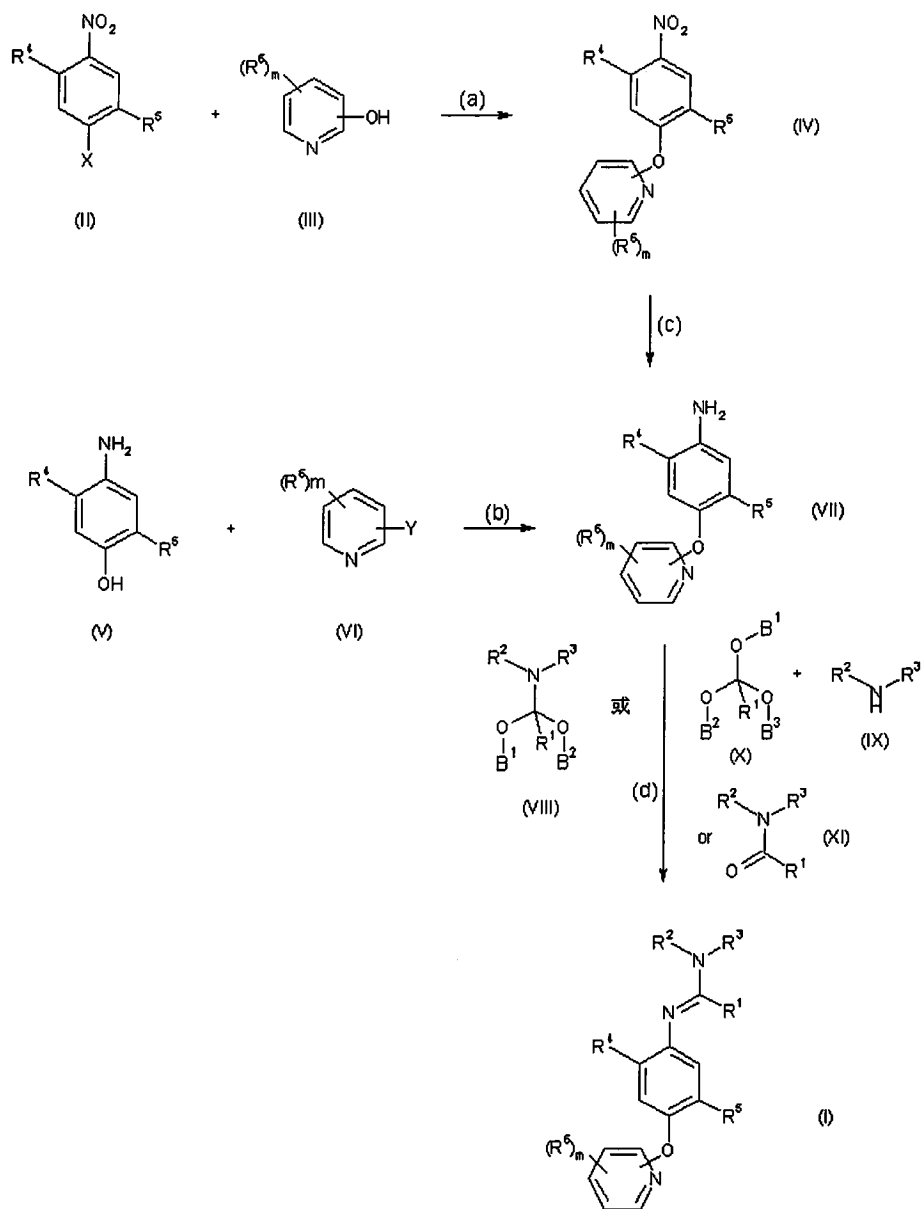
R^4 表示甲基；

R^5 表示甲基；

m表示1；

R^6 表示2-溴。

6. 一种制备如权利要求1至5中任一项所述的化合物的方法,该方法包括以下步骤：



其中, X 表示卤素、三氟甲磺酸基、SOMe、甲磺酸基或甲苯磺酸基; Y 表示卤素、三氟甲磺酸基、SOMe、甲磺酸基或甲苯磺酸基; B^1 、 B^2 和 B^3 各自表示烷基。

7. 一种控制农作物中植物病原真菌的方法, 其特征在于, 将农药有效且非植物毒性量的如权利要求 1 至 5 中任一项所述的化合物施用到植物生长或能够生长的土壤中, 施用到植物叶子和 / 或植物果实上, 或者施用到植物种子上。

具有杀真菌活性的吡啶氧基取代的苯脒衍生物

[0001] 说明

[0002] 本发明涉及 2,5- 二取代的 -4- 吡啶氧基 - 取代的 - 苯基 - 脒衍生物,特别是 2,5- 二烷基 -4- 吡啶氧基 - 取代的 - 苯基 - 脒衍生物,以及它们的制备方法和作为杀真菌活性试剂(特别是以杀真菌组合物的形式的活性试剂)的用途,以及用这些化合物或组合物来控制植物病原真菌(尤其是植物的植物病原真菌)的方法。

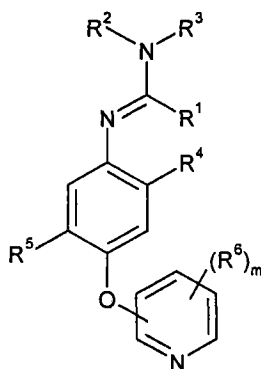
[0003] 在国际专利申请 WO-00/46184 中揭示了某些苯脒衍生物。但是,该文献中没有具体揭示也没有提出在这些化合物中选出其中苯环依据本发明被取代因而具有出乎意料且明显提高的杀真菌活性的化合物。

[0004] 在农业领域中,为了避免或控制对活性成分有耐药性的菌株产生,人们对于使用新型农药化合物一直很感兴趣。而且,为了减少活性化合物的用量,同时保持与已知化合物至少等同的效力,人们对于使用比那些已知的农药活性更高的新化合物也很感兴趣。

[0005] 本发明人现已发现一类具有上述效果或益处的新化合物。

[0006] 因此,本发明提供通式 (I) 的 2,5- 二取代的 -4- 吡啶氧基 - 取代的 - 苯基 - 脒衍生物及其盐、N- 氧化物 (N-oxydes)、金属络合物、准金属络合物和光学活性或几何异构体:

[0007]



(I)

[0008] 式中:

[0009] R^1 表示 H、取代或未取代的 C_1-C_{12} - 烷基、取代或未取代的 C_2-C_{12} - 烯基、取代或未取代的 C_2-C_{12} - 炔基、SH 或取代或未取代的 $S-C_1-C_{12}$ - 烷基;

[0010] R^2 表示取代或未取代的 C_1-C_{12} - 烷基;

[0011] R^3 表示取代或未取代的 C_2-C_{12} - 烷基、取代或未取代的 C_3-C_6 - 环烷基、取代或未取代的 C_2-C_{12} - 烯基、取代或未取代的 C_2-C_{12} - 炔基、卤代 $-C_1-C_{12}$ - 烷基;或者

[0012] R^1 和 R^2 、 R^1 和 R^3 或 R^2 和 R^3 可以一起形成取代或未取代的 5 至 7 元杂环;

[0013] R^4 表示取代或未取代的 C_1-C_{12} - 烷基、卤原子、卤代 $-C_1-C_{12}$ - 烷基、取代或未取代的 $O-C_1-C_{12}$ - 烷基或氰基;

[0014] R^5 表示 H、取代或未取代的 C_1-C_{12} - 烷基、卤原子、卤代 $-C_1-C_{12}$ - 烷基、取代或未取代的 $O-C_1-C_{12}$ - 烷基或氰基;

[0015] m 表示 1、2、3 或 4;

[0016] R^6 表示 H、卤素、氰基、取代或未取代的苯氧基、取代或未取代的苯基、取代或未取代的 C_1-C_{12} -烷基或卤代 $-C_1-C_{12}$ -烷基、 NR^7R^8 、 OR^7 、 SR^7 、三烷基甲硅烷基、 $COOR^7$ 、 $C(R^7) = NOR^8$;

[0017] R^7 、 R^8 表示 H、取代或未取代的 C_1-C_{12} -烷基、芳基;

[0018] R^7 和 R^8 可形成取代或未取代的饱和或不饱和的 5 至 7 元杂环。

[0019] 本发明的任何化合物可根据化合物中不对称中心的数目以一种或多种光学或手性异构体的形式存在。因此,本发明同样涉及所有光学异构体和它们的外消旋或非外消旋 (scalemic) 混合物 (术语“非外消旋”指对映异构体以不同比例混合的混合物),本发明也涉及所有可能的以任何比例混合的立体异构体混合物。可根据本领域技术人员已知的方法分离非对映异构体和 / 或光学异构体。

[0020] 本发明的任何化合物可根据化合物中双键的数目以一种或多种几何异构体的形式存在。因此,本发明同样涉及所有几何异构体和它们以所有可能的比例混合的所有可能的混合物。可通过本领域技术人员已知的常规方法分离几何异构体。

[0021] 对于本发明的化合物,卤素表示氟、溴、氯或碘中的一种,杂原子可以是氮、氧或硫。

[0022] 优选的依据本发明的通式 (I) 的化合物是具有以下特征的化合物: R^1 表示 H; C_1-C_{12} -烷基,优选 C_1-C_{12} -烷基如甲基和乙基;或 SH。

[0023] 其它优选的依据本发明的通式 (I) 的化合物是具有以下特征的化合物: R^2 表示甲基或乙基。

[0024] 另外还有优选的依据本发明的通式 (I) 的化合物是具有以下特征的化合物: R^3 表示 C_2-C_{12} -烷基,优选未取代的 C_2-C_4 -烷基如乙基、正丙基、异丙基; C_2-C_{12} -烯基,优选 C_3-C_4 -烯基如丙烯基或烯丙基; C_3-C_6 -环烷基如环丙基。

[0025] 还有一些优选的依据本发明的通式 (I) 的化合物是具有以下特征的化合物: R^2 和 R^3 可一起形成取代或未取代的 5 至 7 元杂环,优选 6-元杂环,更优选的是哌啶基或吡咯烷基 (pyrrolidinyl),特别优选二-烷基化的-吡咯烷基如二-甲基-吡咯烷基。

[0026] 还有一些优选的依据本发明的通式 (I) 的化合物是具有以下特征的化合物: R^4 表示 C_1-C_{12} -烷基,优选未取代的 C_1-C_{12} -烷基如甲基和乙基;卤原子如氯原子。

[0027] 还有一些优选的依据本发明的通式 (I) 的化合物是具有以下特征的化合物: R^5 表示 C_1-C_{12} -烷基、更优选的是未取代的 C_1-C_{12} -烷基 (如甲基和乙基)、卤原子 (如氯原子)。

[0028] 还有一些优选的依据本发明的通式 (I) 的化合物是具有以下特征的化合物: R^6 表示 H、卤素、氰基、取代或未取代的 C_1-C_{12} -烷基或卤代 $-C_1-C_{12}$ -烷基、 NR^7R^8 、 OR^7 、 SR^7 、 $COOR^7$ 。

[0029] 还有一些优选的依据本发明的通式 (I) 的化合物是具有以下特征的化合物: R^7 或 R^8 各自独立地表示 H、甲基、乙基、芳基,优选取代的苯基,或者可形成取代或未取代的饱和或不饱和的 5 至 7 元杂环,优选的是哌啶基或吗啉基。

[0030] 上述关于本发明化合物的取代基的优选方案可以任何方式组合。因此这些优选特征的组合提供了多种类别的依据本发明的化合物。这些类别的本发明优选化合物的例子可具有以下组合特征:

[0031] R^1 的优选特征与 R^2 至 R^8 的优选特征;

[0032] R^2 的优选特征与 R^1 至 R^8 的优选特征;

[0033] R^3 的优选特征与 R^1 至 R^8 的优选特征；

[0034] R^4 的优选特征与 R^1 至 R^8 的优选特征；

[0035] R^5 的优选特征与 R^1 至 R^8 的优选特征；

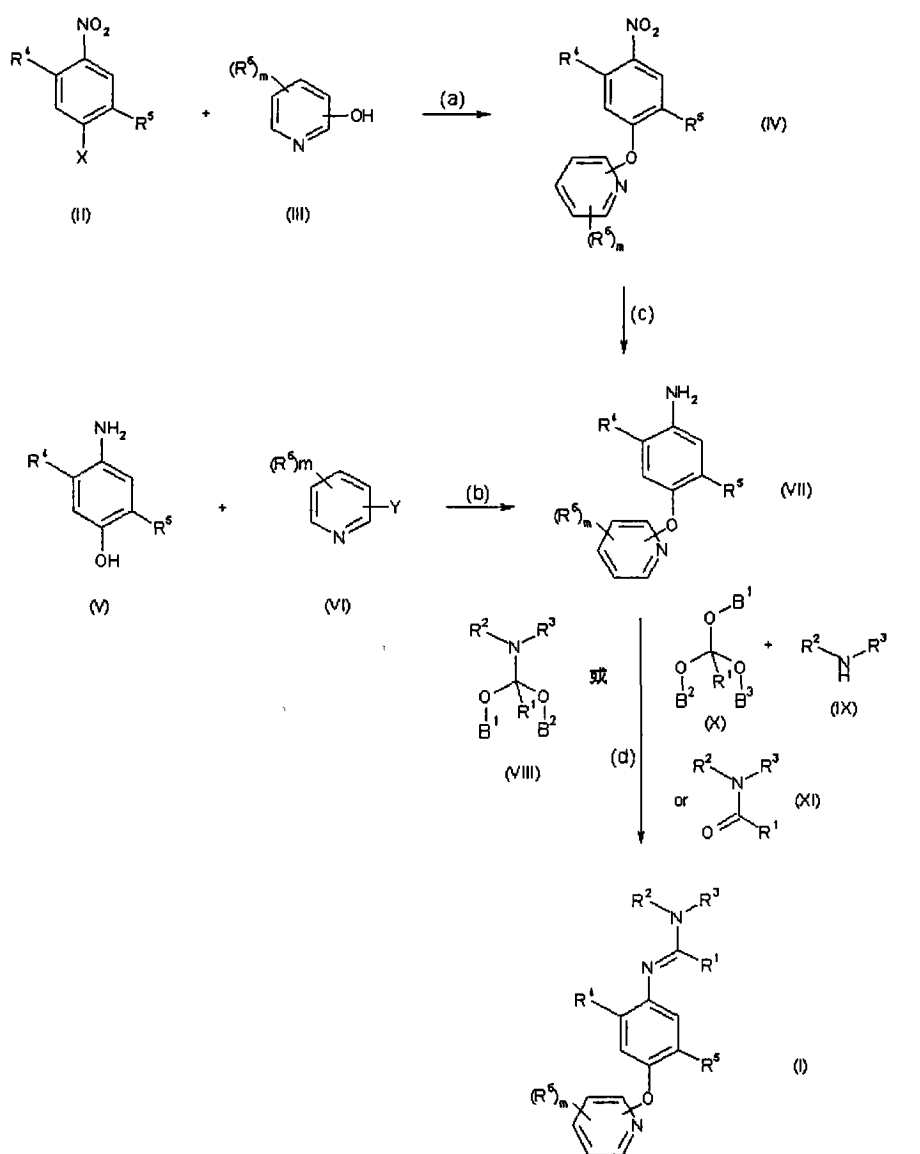
[0036] R^6 的优选特征与 R^1 至 R^8 的优选特征；

[0037] R^7 的优选特征与 R^1 至 R^8 的优选特征。

[0038] 在这些依据本发明的化合物的取代基的优选特征的组合中,所述优选特征还可选自各 R^1 - R^6 的更优选特征,以形成最优选的依据本发明的化合物类别。

[0039] 本发明还涉及一种制备通式 (I) 的化合物的方法。依据本发明的通式 (I) 的化合物一般可按照流程 1 进行制备。

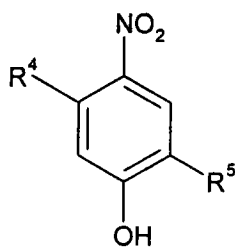
[0040]



[0041] 流程 1

[0042] 通式 (IV) 的硝基苯醚衍生物可依据方法 (a) 通过使通式 (II) 的硝基苯衍生物与通式 (III) 的羟基吡啶衍生物反应来制备；

[0043]



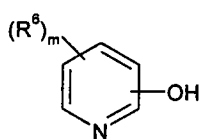
(II)

[0044] 式中

[0045] R^4 和 R^5 如文中所定义，

[0046] X 表示卤素、三氟甲磺酸基 (triflate)、SOMe、甲磺酸基 (mesylate) 或甲苯磺酸基 (tosylate)；

[0047]



(III)

[0048] 式中

[0049] R^6 和 m 如文中所定义。

[0050] 依据本发明的方法步骤 (a) 还包括一个或多个以下特征：

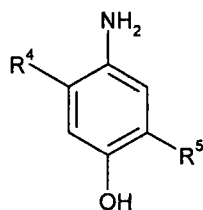
[0051] 存在碱；

[0052] 存在稀释剂；

[0053] 存在催化剂。

[0054] 通式 (VII) 的苯胺衍生物可依据方法 (b) 通过使通式 (V) 的苯胺衍生物与通式 (VI) 的吡啶衍生物反应来制备：

[0055]

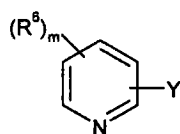


(V)

[0056] 式中

[0057] R^4 和 R^5 如文中所定义；

[0058]



[0059] 通式 (V)

[0060] 式中

[0061] R^6 和 m 如文中所定义，

[0062] Y 表示卤素、三氟甲磺酸基、SOMe、甲磺酸基或甲苯磺酸基。

[0063] 依据本发明的方法 (b) 还包括一个或多个以下特征：

[0064] 存在碱；

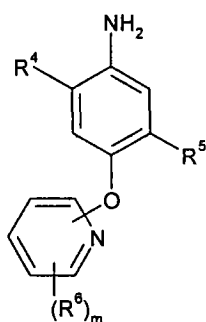
[0065] 存在稀释剂；

[0066] 存在催化剂。

[0067] 方法 (b) 之后进行方法 (c)，使通式 (IV) 的硝基苯醚衍生物还原。较佳地，还原反应在氯化亚锡存在下在浓盐酸中进行。

[0068] 通式 (I) 的脒衍生物可以依据方法步骤 (d) 通过使通式 (VII) 的苯胺衍生物发生反应来制备：

[0069]



(VII)

[0070] 式中

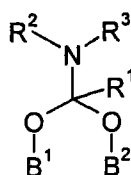
[0071] R^4 、 R^5 、 R^6 和 m 如文中所定义。

[0072] 可以考虑依据本发明的方法 (d) 的各种替换方式，它们称为依据本发明的方法 (d1)、方法 (d2) 和方法 (d3)。

[0073] 依据本发明的方法 (d) 包括使通式 (VII) 的苯胺衍生物与不同反应物反应，从而分别定义为方法 (d1)、(d2) 和 (d3)。

[0074] 方法 d1 中还使用通式 (VIII) 的氨基-缩醛衍生物：

[0075]



(VIII)

[0076] 式中

[0077] R^1 、 R^2 、 R^3 如文中所定义；

[0078] B^1 和 B^2 分别表示烷基，或者一起形成环烷基。

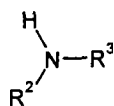
[0079] 依据本发明的方法 (d1) 还包括一个或多个以下特征：

[0080] 存在酸或碱；

[0081] 存在稀释剂。

[0082] 方法 d2 中还使用通式 (IX) 的胺衍生物，在通式 (X) 的原酸酯衍生物存在下进行反应：

[0083]

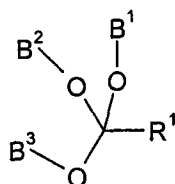


(IX)

[0084] 式中

[0085] R^2 和 R^3 如文中所定义；

[0086]



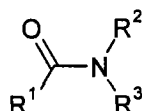
(X)

[0087] 式中

[0088] R^1 如文中所定义；[0089] B^1 、 B^2 和 B^3 各自表示烷基。

[0090] 方法 d3 中还使用通式 (XI) 的酰胺衍生物；

[0091]



(XI)

[0092] 式中

[0093] R^1 、 R^2 、 R^3 如文中所定义。

[0094] 依据本发明的方法 (d3) 还包括一个或多个以下特征：

[0095] 存在卤化剂，例如 PCl_5 、 PCl_3 、 POCl_3 、 SOCl_2 ；

[0096] 存在稀释剂。

[0097] 适用于进行本发明的方法 (a)、(b) 和 (c) 的稀释剂是所有普通惰性有机溶剂。优选使用脂族、脂环族或芳族烃，例如石油醚、己烷、庚烷、环己烷、甲基环己烷、苯、甲苯、二甲苯或萘烷；卤代烃，例如氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷；醚，例如二乙醚、二异丙醚、甲基叔丁基醚、甲基叔戊基醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷或茴香醚；腈，例如乙腈、丙腈、正丁腈或异丁腈或苯甲腈；酰胺，例如 N, N-二甲基甲酰胺、N, N-二甲基乙酰胺、N-甲基甲酰苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲基磷酸三酰胺；它们与水的混合物，或者纯水。

[0098] 在各种情况下，适用于进行本发明的方法 (d1)、(d2) 和 (d3) 的稀释剂都是所有普通惰性有机溶剂。优选使用脂族、脂环族或芳族烃，例如石油醚、己烷、庚烷、环己烷、甲基环己烷、苯、甲苯、二甲苯或萘烷；醚，例如二乙醚、二异丙醚、甲基叔丁基醚、甲基叔戊基醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷或茴香醚；腈，例如乙腈、丙腈、正丁腈或异丁腈或苯甲腈；酰胺，例如 N, N-二甲基甲酰胺、N, N-二甲基乙酰胺、N-甲基甲酰苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲基磷酸三酰胺；酯，例如乙酸甲酯或乙酸乙酯；亚砷，例如二

甲亚砷；或者砷，例如环丁砷 (sulpholane)；醇，例如甲醇、乙醇、正丙醇或异丙醇、正丁醇、异丁醇、仲丁醇或叔丁醇、乙二醇、1,2-丙二醇、乙氧基乙醇、甲氧基乙醇、二甘醇单甲醚、二甘醇单乙醚；它们与水的混合物，或者纯水。

[0099] 适用于进行本发明的方法 (a)、(b) 和 (c) 的酸结合剂 (acid binder) 是所有常用于这类反应的无机碱和有机碱。优选使用碱土金属或碱金属氢化物、氢氧化物、氨基化合物、醇盐、乙酸盐、碳酸盐或碳酸氢盐，例如氢化钠、氨基钠、二异丙基氨基锂、甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钾、乙酸钠、乙酸钾、乙酸钙、氢氧化钠、氢氧化钾、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钾、碳酸氢钠或碳酸铵；以及叔胺，例如三甲胺、三乙胺、三丁胺、N, N-二甲基苯胺、N, N-二甲基-苄胺、吡啶、N-甲基吡啶、N-甲基吗啉、N, N-二甲基氨基吡啶、二氮杂二环辛烷 (DABCO)、二氮杂二环壬烯 (DBN) 或二氮杂二环十一碳烯 (DBU)。

[0100] 在各种情况下，适用于进行本发明的方法 (b)、(c) 和 (d) 的酸结合剂都是所有常用于这类反应的无机碱和有机碱。优选使用碱土金属或碱金属氢化物、氢氧化物、氨基化合物、醇盐、乙酸盐、氟化物、磷酸盐、碳酸盐或碳酸氢盐，例如氢化钠、氨基钠、二异丙基氨基锂、甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钾、氢氧化钠、氢氧化钾、乙酸钠、磷酸钠、磷酸钾、氟化钾、氟化铯、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钾、碳酸氢钠、碳酸氢钠或碳酸铯；以及叔胺，例如三甲胺、三乙胺、三丁胺、N, N-二甲基苯胺、N, N-二甲基-苄胺、吡啶、N-甲基吡啶、N-甲基吗啉、N, N-二甲基氨基吡啶、二氮杂二环辛烷 (DABCO)、二氮杂二环壬烯 (DBN) 或二氮杂二环十一碳烯 (DBU)。

[0101] 适用于进行本发明的方法 (d1) 的酸是所有常用于这类反应的无机酸和有机酸。优选使用对甲苯磺酸、甲磺酸、盐酸（气体、水溶液或有机溶液）或硫酸。

[0102] 适用于进行本发明的方法 (d3) 的缩合剂 (condensing agent) 是所有常用于这类氨基化反应的缩合剂。优选使用酰卤形成剂，例如光气、三溴化磷、三氯化磷、五氯化磷、三氯氧磷或亚硫酸氯；酸酐形成剂，例如氯甲酸乙酯、氯甲酸甲酯、氯甲酸异丙酯、氯甲酸异丁酯或甲磺酰氯；碳二亚胺，例如 N, N'-二环己基碳二亚胺 (DCC) 或其它常用缩合剂，例如五氧化二磷、多磷酸、N, N'-羰基二咪唑、2-乙氧基-N-乙氧基羰基-1,2-二氢喹啉 (EEDQ)、三苯膦 / 四氯甲烷或溴代三吡咯烷基六氟磷酸磷 (phosphonium-hexafluorophosphate)。

[0103] 本发明的通式 (I) 的化合物可依据文中所描述的方法制备。然而要理解，本领域技术人员基于其所掌握的常识和可获得的出版物，可以根据所需合成的各种具体化合物对本发明方法进行相应调整。

[0104] 另一方面，本发明还涉及含有有效且非植物毒性量的通式 (I) 的活性化合物的杀真菌组合物。

[0105] “有效且非植物毒性量”的表达方式指本发明组合物的量足以控制或破坏存在于或易于出现在农作物上的真菌，而该剂量并不会使所述农作物产生任何可以观察到的植物毒性症状。该量根据以下因素会在很宽的范围内变化：要控制的真菌、农作物的类型、气候条件和包含在本发明的杀真菌组合物中的化合物。

[0106] 该量可通过系统田间试验来确定，这在本领域技术人员的能力范围内。

[0107] 因此，依据本发明，提供一种杀真菌组合物，该组合物包含有效量的上述通式 (I) 的化合物作为活性组分和农业上可接受的担体 (support)、载体或填充物 (filler)。

[0108] 依据本发明,术语“担体”表示天然或合成的有机或无机化合物,它与通式(I)的活性化合物组合或联合使用,使活性材料更容易施用,特别是施用到植物各部分上。因此,此担体通常是惰性的,并且应该是农业上可接受的。担体可为固体或液体。合适的担体的例子包括粘土、天然或合成的硅酸盐、二氧化硅、树脂、蜡、固体肥料、水、醇(特别是丁醇)、有机溶剂、矿物油和植物油以及它们的衍生物。也可以使用这些担体的混合物。

[0109] 依据本发明的组合物也可以包含其它的组分。具体地,组合物还可包含表面活性剂。表面活性剂可为离子或非离子型乳化剂、分散剂或润湿剂或这些表面活性剂的混合物。例如,聚丙烯酸盐、木质素磺酸盐、苯酚磺酸盐或萘磺酸盐、环氧乙烷与脂肪醇或脂肪酸或脂肪胺的缩聚物、取代的苯酚(特别是烷基苯酚或芳基苯酚)、磺基琥珀酸酯的盐、牛磺酸衍生物(特别是牛磺酸烷基酯(alkyl taurate))、聚氧乙基化醇或苯酚的磷酸酯、多元醇的脂肪酸酯,以及含有硫酸、磺酸和磷酸官能团的上述化合物的衍生物。当活性物质和/或惰性担体是不溶于水,并且当施用的媒介剂是水时,存在至少一种表面活性剂通常是至关重要的。较佳地,以组合物的重量为基准计,表面活性剂的含量为5重量%至40重量%。

[0110] 任选地,还可包括附加的组分,例如,保护性胶体、胶粘剂、增稠剂、触变剂、渗透剂、稳定剂(stabilisers)、螯合剂(sequestering agent)。一般来说,活性化合物可根据常用的配方技术与任何固体或液体添加剂相混合。

[0111] 本发明的组合物一般可含有0.05重量%至99重量%的活性化合物,较佳为10重量%至70重量%。

[0112] 本发明的组合物可以各种形式使用,诸如气雾分散剂、微囊悬浮剂、冷雾浓缩剂、可撒粉剂、可乳化的浓缩剂、水包油乳剂、油包水乳剂、微囊粒剂、细粒剂、种子处理用可流动的浓缩剂、压缩气体(在压力下)制剂、气体发生剂、颗粒剂、热雾浓缩剂、大粒剂、微粒剂、油可分散性粉剂、油可混溶性可流动的浓缩剂、油可混溶液体、糊剂、植物棒剂、干种子处理用粉剂、农药包衣的种子、可溶性浓缩剂、可溶性粉剂、种子处理用溶液、悬浮浓缩剂(可流动的浓缩剂)、超低量(u1v)液体、超低量(u1v)悬浮剂、水可分散粒剂或片剂、浆液处理用水可分散粉剂、水溶性粒剂或片剂、种子处理用水溶性粉剂和可润湿性粉剂。

[0113] 这些组合物不仅包括通过合适的设备如喷雾或撒粉设备施用到待处理的植物或种子上的现成组合物,还包括在施用到农作物之前必须稀释的浓缩商品组合物。

[0114] 依据本发明的化合物还可与一种或多种以下物质混合:杀虫剂、杀真菌剂、杀细菌剂、引诱剂、杀螨剂或信息素活性物质或其它有生物活性的化合物。这样得到的混合物具广谱的活性。

[0115] 与其它杀真菌化合物的混合物尤其有利。合适的可进行混合的杀真菌剂的例子选自以下:

[0116] B1) 能抑制核酸合成的化合物,例如苯霜灵、苯霜灵-M(benalaxyl-M)、乙嘧啶磺酸酯、赤拉灵(chiralaxyl)、柯罗泽尔昆(clozylacon)、甲菌定、乙嘧啶、呋霜灵、恶霉灵、甲霜灵、高效甲霜灵、呋酰胺、恶霜灵、喹菌酮;

[0117] B2) 能够抑制有丝分裂和细胞分裂的化合物,例如苯菌灵、多菌灵、乙霉威、麦穗宁、戊菌隆、噻菌灵、甲基硫菌灵、苯酰菌胺;

[0118] B3) 能抑制呼吸的化合物,例如

[0119] CI-呼吸抑制剂,如氟嘧菌胺(diflumetorim);

[0120] CII-呼吸抑制剂,如啉酰菌胺(boscalid)、萎锈灵、甲呋酰胺、氟酰胺、呋吡菌胺(furametpyr)、灭锈胺、氧化萎锈灵(oxycarboxine)、吡噻菌胺(penthiopyrad)、噻氟菌胺;

[0121] CIII-呼吸抑制剂,如嘧菌酯、氰霜唑、醚菌胺(dimoxystrobin)、厄内斯卓宾(enestrobin)、恶唑菌酮、咪唑菌酮、氟嘧菌酯(fluxastrobin)、醚菌酯、苯氧菌胺、肟醚菌胺(orysastrobin)、唑菌胺酯(pyraclostrobin)、啉氧菌酯(picoxystrobin)、肟菌酯;

[0122] B4) 能起解偶联剂作用的化合物,例如消螨普、氟啉胺;

[0123] B5) 能抑制 ATP 产生的化合物,例如三苯基乙酸锡、三苯基氯化锡、三苯基氢氧化锡、硅噻菌胺(silthiofam);

[0124] B6) 能抑制 AA 和蛋白质生物合成的化合物,例如胺扑灭(andoprim)、杀稻瘟菌素-S、嘧菌环胺、春雷霉素、水合盐酸春雷霉素(kasugamycinhydrochloride hydrate)、嘧菌胺、嘧霉胺;

[0125] B7) 能抑制信号转导的化合物,例如拌种咯、咯菌腈、苯氧喹啉;

[0126] B8) 能抑制脂和膜合成的化合物,例如乙菌利、异菌脲、腐霉利、乙烯菌核利、吡菌磷、敌瘟磷、异稻瘟净(IBP)、稻瘟灵、甲基立枯磷、联苯、依杜卡(iodocarb)、霜霉威、霜霉威盐酸盐;

[0127] B9) 能抑制麦角固醇生物合成的化合物,例如环酰菌胺、氧环唑、联苯三唑醇、糠菌唑、环丙唑醇、苄氯三唑醇(diclobutrazole)、苯醚甲环唑、烯唑醇、烯唑醇-M(diniconazole-M)、氟环唑、乙环唑、腈苯唑、氟唑唑、氟硅唑、粉唑醇、呋菌唑、呋醚唑、己唑醇、亚胺唑、种菌唑、叶菌唑、腈菌唑、多效唑、戊菌唑、丙环唑、丙硫菌唑(prothioconazole)、硅氟唑、戊唑醇、四氟醚唑、三唑酮、三唑醇、灭菌唑、烯效唑、伏立康唑、抑霉唑、抑霉唑硫酸盐(imazalil sulfate)、恶咪唑、氯苯吡啶醇、呋唑醇、氟苯吡啶醇、啉斑肟、噻胺灵、稻瘟酯、咪鲜胺、氟菌唑、烯霜苄(viniconazole)、阿尔迪莫(aldimorph)、十二环吗啉、十二环吗啉乙酸酯(dodemorph acetate)、丁苯吗啉(fenpropimorph)、十三吗啉、苯锈啉、螺环菌胺、萘替芳、稗草丹、特比萘芬;

[0128] B10) 能抑制细胞壁合成的化合物,例如苯噻菌胺(benthiavalicarb)、双丙氨膦、烯酰吗啉、氟吗啉、异丙菌胺、多抗霉素(polyoxins)、多氧霉素(polyoxorim)、有效霉素 A;

[0129] B11) 能抑制黑素生物合成的化合物,例如环丙酰菌胺、双氯氰菌胺、氰菌胺、四氯苯酞(phthalide)、咯嗪酮、三环唑;

[0130] B12) 能诱导宿主防御的化合物,例如活化酯-S-甲基(acibenzolar-S-methyl)、噻菌灵、噻酰菌胺(tiadinil);

[0131] B13) 具有多位点(multisite)作用的化合物,例如敌菌丹、克菌丹、百菌清、铜制剂如氢氧化铜、环烷酸铜、氯化铜、硫酸铜、氧化铜、喹啉铜和波尔多液、抑菌灵、二噻农、多果定、多果定游离碱、福美铁、氟佛匹特(fluorofolpet)、灭菌丹、双胍辛(guazatine)、双胍辛乙酸盐、双胍辛胺、双胍三辛烷基苯磺酸盐(iminoctadine albesilate)、双胍辛胺三乙酸盐、代森锰铜、代森锰锌、代森锰、代森联(metiram)、代森联锌(metiram zinc)、丙森锌、硫和硫制剂,包括多硫化钙、福美双、甲苯氟磺胺、代森锌、福美锌;

[0132] B14) 选自以下的化合物:阿密布洛姆朵尔(amibromdole)、苯噻硫氰、贝斯氧杂嗪(bethoxazin)、卡巴西霉素、香芹酮、灭螨猛、氯化苦、硫杂灵(cufraneb)、环氟菌胺

(cyflufenamid)、霜脍氰、棉隆、咪菌威、哒菌酮、双氯酚、氯硝胺、野燕枯、野燕枯甲基硫酸盐(difenzoquat methylsulphate)、二苯胺、噻唑菌胺、嘧菌腈、氟酰菌胺、磺菌胺、藻菌磷铝、藻菌磷钙、藻菌磷钠、氟吡菌胺(fluopicolide)、氟氯菌核利(fluoroimide)、六氯苯、8-羟基喹啉硫酸盐、人间霉素(irumamycin)、磺菌威(methasulphocarb)、苯菌酮(metrafenone)、异硫氰酸甲酯、灭粉霉素、那他霉素、二甲基二硫代氨基甲酸镍、酞菌酯、辛噻酮、奥克斯莫卡宾(oxamocarb)、氧代奋欣(oxyfenthiin)、五氯苯酚和盐、2-苯基苯酚和盐、亚磷酸及其盐、病花灵、普罗帕诺欣(propanosine)-钠、丙氧喹啉(proquinazid)、吡咯叠氮(pyrrolnitrite)、五氯硝基苯、叶枯酞、四氯硝基苯、咪唑嗪、水杨菌胺、氰菌胺和2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺酰基)-吡啶、N-(4-氯-2-硝基苯基)-N-乙基-4-甲基-苯磺酰胺、2-氨基-4-甲基-N-苯基-5-噻唑羧酰胺、2-氯-N-(2,3-二氢-1,1,3-三甲基-1H-茛-4-基)-3-吡啶羧酰胺、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基异噁唑烷-3-基]吡啶、顺式-1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-环庚醇、1-(2,3-二氢-2,2-二甲基-1H-茛-1-基)-1H-咪唑-5-羧酸甲酯、3,4,5-三氯-2,6-吡啶二腈、2-[[[环丙基[(4-甲氧基苯基)亚氨基]甲基]巯基(thio)]甲基]-α-(甲氧基亚甲基)-苯乙酸甲酯、4-氯-α-丙炔氧基-N-[2-[3-甲氧基-4-(2-丙炔氧基)苯基]乙基]-苯乙酰胺、(2S)-N-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔基]氧基(oxy)]]-3-甲氧基苯基]乙基]-3-甲基-2-[(甲基磺酰基)氨基]-丁酰胺、5-氯-7-(4-甲基哌啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]吡啶、5-氯-6-(2,4,6-三氟苯基)-N-[(1R)-1,2,2-三甲基丙基][1,2,4]三唑并[1,5-a]吡啶-7-胺、5-氯-N-[(1R)-1,2-二甲基丙基]-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]吡啶-7-胺、N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯烟酰胺、N-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)甲基-2,4-二氯烟酰胺、2-丁氧基-6-碘代-3-丙基-苯并吡喃-4-酮、N-{(Z)-[(环丙基甲氧基)亚氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苯基乙酰胺、N-(3-乙基-3,5,5-三甲基-环己基)-3-甲酰氨基-2-羟基-苯甲酰胺、2-[[[[1-[3(1-氟-2-苯基乙基)氧基]苯基]亚乙基]氨基]氧基]甲基]-α-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-α-E-苯乙酰胺、N-{2-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]乙基}-2-(三氟甲基)苯甲酰胺、N-(3',4'-二氯-5-氟联苯-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、2-(2-[[6-(3-氯-2-甲基苯氧基)-5-氟吡啶-4-基]氧基]苯基)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、1-[(4-甲氧基苯氧基)甲基]-2,2-二甲基丙基-1H-咪唑-1-羧酸、0-[1-[(4-甲氧基苯氧基)甲基]-2,2-二甲基丙基]-1H-咪唑-1-硫代羧酸。

[0133] 包含通式(I)的化合物和杀细菌剂化合物的混合物也是本发明的一种特别好的组合物。合适的可进行混合的杀细菌剂的例子可选自以下:溴硝醇、双氯酚、氯定、二甲基二硫代氨基甲酸镍、春雷霉素、辛噻酮、呋喃羧酸、土霉素、噻菌灵、链霉素、叶枯酞、硫酸铜和其它铜制剂。

[0134] 本发明的通式(I)的化合物和杀真菌组合物可用来治疗性或预防性地控制植物或农作物的植物病原真菌。因此,本发明还提供了一种治疗性或预防性地控制植物或农作物植物病原真菌的方法,该方法的特征在于将本发明的通式(I)的化合物或杀真菌组合物施用到种子、植物或植物的果实或植物正在生长或需要生长的土壤中。

[0135] 本发明的处理方法还可用于处理繁殖材料如块茎或根茎, 以及种子、幼苗或移植

(pricking out) 苗和植物或移植植物。该处理方法也可用于处理根。本发明的处理方法也可用于处理植物的地上部分如有关植物的干、茎或梗、叶子、花和果实。

[0136] 在可用本发明的方法保护的植物中,包括棉花;亚麻;葡萄藤;果实或蔬菜作物,诸如蔷薇科 (*Rosaceae* sp.) (例如,仁果类水果,诸如苹果和梨,还有核果,诸如杏、杏仁和桃子)、茶藨子科 (*Ribesioideae* sp.)、胡桃科 (*Juglandaceae* sp.)、桦木科 (*Betulaceae* sp.)、漆树科 (*Anacardiaceae* sp.)、山毛榉科 (*Fagaceae* sp.)、桑科 (*Moraceae* sp.)、木犀科 (*Oleaceae* sp.)、猕猴桃科 (*Actinidaceae* sp.)、樟科 (*Lauraceae* sp.)、芭蕉科 (*Musaceae* sp.) (例如香蕉树和粉芭蕉 (plantains))、茜草科 (*Rubiaceae* sp.)、山茶科 (*Theaceae* sp.)、梧桐科 (*Sterculiaceae* sp.)、芸香科 (*Rutaceae* sp.) (例如柠檬、橙子和葡萄柚);茄科 (*Solanaceae* sp.) (例如,西红柿)、百合科 (*Liliaceae* sp.)、紫菀科 (*Asteraceae* sp.) (例如莴苣)、伞形科 (*Umbelliferae* sp.)、十字花科 (*Cruciferae* sp.)、藜科 (*Chenopodiaceae* sp.)、葫芦科 (*Cucurbitaceae* sp.)、蝶形花科 (*Papilionaceae* sp.) (例如豌豆)、蔷薇科 (*Rosaceae* sp.) (例如草莓);大作物,诸如禾本科 (*Graminae* sp.) (例如玉米、菌苔或谷物如小麦、稻、大麦和黑小麦)、紫菀科 (*Asteraceae* sp.) (例如向日葵)、十字花科 (*Cruciferae* sp.) (例如油菜)、豆科 (*Fabaceae* sp.) (例如花生)、蝶形花科 (*Papilionaceae* sp.) (例如大豆)、茄科 (*Solanaceae* sp.) (例如马铃薯)、藜科 (*Chenopodiaceae* sp.) (例如甜菜根);园艺作物和森林作物;以及这些作物的遗传修饰的同系物。

[0137] 在可通过本发明方法控制的植物或农作物疾病中,可提及的有:

[0138] 白粉病 (powdery mildew),例如:

[0139] 小麦白粉病 (*Blumeria* diseases),例如由小麦白粉菌 (*Blumeria graminis*) 引起;

[0140] 叉丝单囊壳属病 (*Podosphaera* diseases),例如由白叉丝单囊壳 (*Podosphaera leucotricha*) 引起;

[0141] 单丝壳属病 (*Sphaerotheca* diseases),例如由苍耳单丝壳 (*Sphaerotheca fuliginea*) 引起;

[0142] 钩丝壳属病 (*Uncinula* diseases),例如由葡萄钩丝壳 (*Uncinula necator*) 引起;

[0143] 锈病,例如:

[0144] 胶锈属病 (*Gymnosporangium* diseases),例如由 *Gymnosporangium sabinae* 引起;

[0145] 驼孢锈病 (*Hemileia* diseases),例如由咖啡驼孢锈菌 (*Hemileia vastatrix*) 引起;

[0146] 层锈菌属病 (*Phakopsora* diseases),例如由豆薯层锈菌 (*Phakopsora pachyrhizi*) 或山马蝗层锈菌 (*Phakopsora meibomia*) 引起;

[0147] 柄锈菌属病 (*Puccinia* diseases),例如由隐匿柄锈菌 (*Puccinia recondita*) 引起;

[0148] 单孢锈菌属病 (*Uromyces* diseases),例如由疣顶单孢锈菌 (*Uromyces appendiculatus*) 引起;

[0149] 卵菌病 (*Oomycete* diseases),例如:

- [0150] 盘梗霉属病 (*Bremia* diseases), 例如由莴苣盘梗霉 (*Bremia lactucae*) 引起;
- [0151] 霜霉属病 (*Peronospora* diseases), 例如由豌豆霜霉 (*Peronospora pisi*) 或芸苔霜霉 (*P. brassicae*) 引起;
- [0152] 疫霉属病 (*Phytophthora* diseases), 例如由致病疫霉 (*Phytophthora infestans*) 引起;
- [0153] 单轴霉属病 (*Plasmopara* diseases), 例如由葡萄生单轴霉 (*Plasmopara viticola*) 引起;
- [0154] 假霜霉属 (*Pseudoperonospora* diseases), 例如由葎草假霜霉 (*Pseudoperonospora humuli*) 或古巴假霜霉 (*Pseudoperonospora cubensis*) 引起;
- [0155] 腐霉属病 (*Pythium* diseases), 例如由终极腐霉 (*Pythium ultimum*) 引起;
- [0156] 叶斑病 (Leafspot disease)、污叶病 (leaf blotch disease) 和叶枯病 (leafblight disease), 例如:
- [0157] 支链孢属病 (*Alternaria* diseases), 例如由茄链格孢 (*Alternaria solani*) 引起;
- [0158] 尾孢霉属病 (*Cercospora* diseases), 例如由甜菜生尾孢 (*Cercospora beticola*) 引起;
- [0159] 金孢子菌属病 (*Cladosporium* diseases), 例如由瓜枝孢 (*Cladosporium cucumerinum*) 引起;
- [0160] 旋孢腔菌病 (*Cochliobolus* diseases), 例如由禾旋孢腔菌 (*Cochliobolus sativus*) 引起;
- [0161] 刺盘孢属病 (*Colletotrichum* diseases), 例如由豆刺盘孢 (*Colletotrichum lindemuthianum*) 引起;
- [0162] 油橄榄孔雀斑病 (*Cycloconium* diseases), 例如由 *Cycloconium oleaginum* 引起;
- [0163] 腐皮壳菌层病 (*Diaporthe* diseases), 例如由桔柑间座壳 (*Diaporthe citri*) 引起;
- [0164] 痂囊腔菌属病 (*Elsinoe* diseases), 例如由桔柑痂囊腔菌 (*Elsinoe fawcettii*) 引起;
- [0165] 长孢属病 (*Gloeosporium* diseases), 例如由悦色盘长孢 (*Gloeosporium laeticolor*) 引起;
- [0166] 小丛壳属病 (*Glomerella* diseases), 例如由围小丛壳 (*Glomerella cingulata*) 引起;
- [0167] 球座菌属病 (*Guignardia* diseases), 例如由葡萄球座菌 (*Guignardia bidwelli*) 引起;
- [0168] 小球腔菌属病 (*Leptosphaeria* diseases), 例如由十字花科小球腔菌 (*Leptosphaeria maculans*); 颖枯小球腔菌 (*Leptosphaeria nodorum*) 引起;
- [0169] 稻瘟病 (*Magnaporthe*), 例如由稻瘟菌 (*Magnaporthe grisea*) 引起;
- [0170] 球腔菌属病 (*Mycosphaerella* diseases), 例如由禾生球腔菌 (*Mycosphaerella graminicola*); 落花生球腔菌 (*Mycosphaerella arachidicola*); 香蕉黑条叶斑病菌

(*Mycosphaerella fijiensis*) 引起；

[0171] 壳针孢属病 (*Phaeosphaeria* diseases), 例如由颖枯壳针孢 (*Phaeosphaeria nodorum*) 引起；

[0172] 核腔菌属病 (*Pyrenophora* diseases), 例如由圆核腔菌 (*Pyrenophora teres*) 引起；

[0173] 柱隔孢属病 (*Ramularia* diseases), 例如由 *Ramularia collo-cygni* 引起；

[0174] 喙孢属病 (*Rhynchosporium* diseases), 例如由黑麦喙孢 (*Rhynchosporium secalis*) 引起；

[0175] 壳针孢属病 (*Septoria* diseases), 例如由芹菜小壳针孢 (*Septoria apii*) 或番茄壳针孢 (*Septoria lycopersici*) 引起；

[0176] 核瑚菌属病 (*Typhula* diseases), 例如由肉孢核瑚菌 (*Typhula incarnata*) 引起；

[0177] 黑星菌属病 (*Venturia* diseases), 例如由苹果黑星菌 (*Venturia inaequalis*) 引起；

[0178] 根和茎疾病, 例如：

[0179] 伏革菌病 (*Corticium* diseases), 例如由禾伏革菌 (*Corticium graminearum*) 引起；

[0180] 镰孢菌 (霉) 属病 (*Fusarium* diseases), 例如由尖镰孢 (*Fusarium oxysporum*) 引起；

[0181] 鲟形属病 (*Gaeumannomyces* diseases), 例如由禾顶囊壳 (*Gaeumannomyces graminis*) 引起；

[0182] 丝核菌属病 (*Rhizoctonia* diseases), 例如由立枯丝核菌 (*Rhizoctonia solani*) 引起；

[0183] *Tapesia* 病, 例如由 *Tapesia acuformis* 引起；

[0184] 根串珠霉属病 (*Thielaviopsis* diseases), 例如由根串珠霉 (*Thielaviopsis basicola*) 引起；

[0185] 耳穗和圆锥花序疾病, 例如：

[0186] 链格孢属病 (*Alternaria* diseases), 例如由链格孢 (*Alternaria* spp.) 引起；

[0187] 曲霉病 (*Aspergillus* diseases), 例如由黄曲霉 (*Aspergillus flavus*) 引起；

[0188] 枝孢属病 (*Cladosporium* diseases), 例如由枝孢 (*Cladosporium* spp.) 引起；

[0189] 麦角菌属病 (*Claviceps* diseases), 例如由麦角菌 (*Claviceps purpurea*) 引起；

[0190] 镰孢菌 (霉) 属病 (*Fusarium* diseases), 例如由大刀镰孢菌 (*Fusarium culmorum*) 引起；

[0191] 赤霉属病 (*Gibberella* diseases), 例如由玉米赤霉 (*Gibberella zeae*) 引起；

[0192] 水稻云形病 (*Monographella*), 例如由 *Monographella nivalis* 引起；

[0193] 黑穗病和腥黑穗病, 例如：

[0194] 轴黑粉菌属病 (*Sphacelotheca* diseases), 例如由丝轴黑粉菌 (*Sphacelotheca reiliana*) 引起；

[0195] 腥黑粉菌属病 (*Tilletia* diseases), 例如由小麦网腥黑粉菌 (*Tilletia caries*)

引起；

[0196] 条黑粉菌属病 (*Urocystis* diseases), 例如由隐条黑粉菌 (*Urocystis occulta*) 引起；

[0197] 黑粉菌属病 (*Ustilago* diseases), 例如由裸黑粉菌 (*Ustilago nuda*) 引起；

[0198] 果实腐烂和霉菌病, 例如：

[0199] 曲霉病 (*Aspergillus* diseases), 例如由黄曲霉 (*Aspergillus flavus*) 引起；

[0200] 葡萄孢属病 (*Botrytis* diseases), 例如由灰葡萄孢 (*Botrytis cinerea*) 引起；

[0201] 青霉菌病 (*Penicillium* diseases), 例如由扩展青霉 (*Penicillium expansum*) 引起；

[0202] 核盘菌属病 (*Sclerotinia* diseases), 例如由核盘菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 引起；

[0203] 轮枝孢属病 (*Verticilium* diseases), 例如由黑白轮枝孢 (*Verticilium albo-atrum*) 引起；

[0204] 种子和土壤传播的腐烂, 霉菌, 枯萎, 腐烂和猝倒病；

[0205] 镰孢菌 (霉) 属病 (*Fusarium* diseases), 例如由大刀镰孢菌 (*Fusarium culmorum*) 引起；

[0206] 疫霉属病 (*Phytophthora* diseases), 例如由恶疫霉 (*Phytophthora cactorum*) 引起；

[0207] 腐霉属病 (*Pythium* diseases), 例如由终极腐霉 (*Pythium ultimum*) 引起；

[0208] 丝核菌属病 (*Rhizoctonia* diseases), 例如由立枯丝核菌 (*Rhizoctonia solani*) 引起；

[0209] 小核菌病 (*Sclerotium* diseases), 例如由齐整小核菌 (*Sclerotium rolfsii*) 引起；

[0210] 微结节菌属病 (*Microdochium* diseases), 例如由雪腐微座孢 (*Microdochium nivale*) 引起；

[0211] 溃疡病 (Canker)、松碎 (broom) 和梢枯病, 例如：

[0212] 丛赤壳属病 (*Nectria* diseases), 例如由干癌丛赤壳菌 (*Nectria galligena*) 引起；

[0213] 枯萎病, 例如：

[0214] 链核盘菌属病 (*Monilinia* diseases), 例如由核果链核盘菌 (*Monilinia laxa*) 引起；

[0215] 叶疱病或缩叶病, 例如：

[0216] 外囊菌属病 (*Taphrina* diseases), 例如由畸形外囊菌 (*Taphrina deformans*) 引起；

[0217] 木质植物的衰退病, 例如：

[0218] Esca 病, 例如由 *Phaemoniella clamydospora* 引起；

[0219] 葡萄顶枯病 (*Eutypa dieback*), 例如由 *Eutypa lata* 引起；

[0220] 榆树荷兰病 (Dutch elm disease), 例如由榆枯萎病菌 (*Ceratocystis ulmi*) 引起；

[0221] 花和种子的疾病,例如:

[0222] 葡萄孢属病 (Botrytis diseases),例如由灰葡萄孢 (Botrytis cinerea) 引起;

[0223] 根茎类疾病,例如:

[0224] 丝核菌属病 (Rhizoctonia diseases),例如由立枯丝核菌 (Rhizoctonia solani) 引起。

[0225] 本发明的杀真菌组合物还可以用来抵抗易于生长在木材上或木材内部的真菌疾病。术语“木材”指所有种类的木材,和对该木材进行加工用于建筑物的加工材料,例如实木、高密度木材、层压木材和胶合板。本发明的处理木材的方法主要包括:使木材与本发明的一种或多种化合物或本发明的组合物接触;这包括例如直接施用、喷涂、浸涂、注入或任何其它合适的方式。

[0226] 在根据本发明的处理方法中,对于应用于叶处理时,活性化合物通常施用剂量优选为 10-800 克/公顷,更好为 50-300 克/公顷。对于种子处理,活性物质的施用剂量通常优选为 2-200 克/100 千克种子,更好为 3-150 克/100 千克种子。

[0227] 应该清楚地理解,上述剂量是作为本发明方法的说明性例子给出。本领域技术人员知道如何根据待处理植物或农作物的性质调节施用剂量。

[0228] 本发明的杀真菌组合物也可以用于处理用本发明的化合物或本发明的农用化学组合物遗传修饰的生物体。遗传修饰的植物是其基因组被稳定地整合入编码感兴趣蛋白的异源基因的植物。“编码感兴趣蛋白的异源基因”主要是指给予转化植物新的农学性质的基因,或指改善改良植物的农学性质的基因。

[0229] 本发明的化合物或混合物也可以用于制备对于治疗性或预防性处理人或动物真菌疾病有用的组合物,这些疾病例如霉菌病 (mycose)、皮肤病、癣菌病和念珠菌病或由曲霉属 (Aspergillus spp.) 如烟曲霉 (Aspergillus fumigatus) 引起的疾病。

[0230] 下面将参考化合物列表和和实施例对本发明的各方面进行说明。下面的列表中列举了本发明的化合物的非限制性实施例。

[0231] 在以下实施例中,质谱中所观察到的 M+1 (或 M-1) 分别指正或负 1a. m. u. (原子质量单位) 的分子离子峰, M(ApcI+) 指通过质谱中的正气压化学电离发现的分子离子峰。

[0232] 在以下实施例中,依据 HPLC (高性能液相色谱) EEC Directive 79/831 Annex V. A8, 使用以下方法在反相柱 (C18) 上测量 logP 值:

[0233] 温度: 40°C; 流动相: 0.1% 的甲酸和乙腈的水溶液; 线性梯度为 10% 乙腈至 90% 乙腈。

[0234] 使用 logP 值已知的直链型烷-2-酮 (包括 3-16 个碳原子) 进行校准 (logP 值是通过使用两个连续烷酮之间的线性内插的保留时间确定的)。

[0235] 使用 190 纳米至 400 纳米的紫外光谱,在色谱信号最大值处确定 $\lambda_{\max}$ 值。

[0236] 制备实施例 1: N-乙基-N-甲基-N'-[4-(2-氯-4-三氟甲基吡啶基)-6-氧基]-2,5-二甲苯基]甲脒-通式 (I) 的化合物

[0237] 将 0.25 克 (0.79 毫摩尔) 4-(2-氯-4-三氟甲基吡啶基)-6-氧基)-2,5-二甲代苯胺溶解在 10 毫升甲醇中,用 0.25 克 N-乙基-N-甲基甲酰胺二甲基缩醛的甲醇溶液 (60%) 进行处理。将该反应混合物在 45°C 搅拌 12 小时,然后在真空下除去溶剂,得到 200 毫克产物 (产率 60%, 纯度 92%); log P (pH 2.3) = 2.39

[0238] ^1H NMR δ (ppm) 1.01 (t, $^3J_{\text{HH}} = 7\text{Hz}$, 3H, CH_3), 1.92 (s, 3H, CH_3), 2.02 (s, 3H, CH_3), 3.21 (s, 3H, NCH_3), 4.01 (q, $^3J_{\text{HH}} = 7\text{Hz}$, 2H, NCH_2), 6.71 (s, 1H, 芳基 -H), 6.86 (s, 1H, 芳基 -H), 7.29 (s, 1H, 芳基 -H), 7.61 (s, 1H, 芳基 -H), 7.65 (b, 1H, 脞 -H).

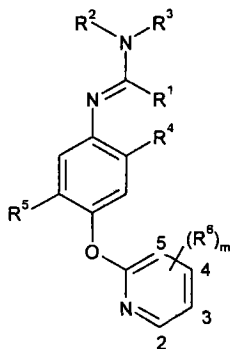
[0239] 原料的制备:

[0240] 4-(2-氯-4-三氟甲基吡啶基-6-氧基)-2,5-二甲代苯胺-通式(VII)的化合物

[0241] 在氩气气氛下,使 1.76 克 (12.86 毫摩尔) 4-氨基-2,5-二甲基苯酚、2.50 克 (11.56 毫摩尔) 2,6-二氯-4-三氟甲基吡啶和 1.95 克 (14.14 毫摩尔) 碳酸钾悬浮在 50 毫升 DMSO 中。将该反应混合物在 120°C 搅拌 6 小时,冷却至室温,用 150 毫升水和 50 毫升 2N 的氢氧化钠水溶液进行处理,用二氯甲烷萃取 (2×100 毫升)。对合并的有机萃取物进行干燥 (MgSO_4),过滤,蒸发至干燥。通过硅胶色谱,用环己烷/乙酸乙酯洗脱对粗产物进行纯化,得到标题化合物,产率为 64% (2.6 克,纯度 92%); $\log P(\text{pH } 2.3) = 2.77$.

[0242] ^1H NMR δ (ppm) 1.92 (s, 3H, CH_3), 2.02 (s, 3H, CH_3), 4.73 (s, 2H, NH_2), 6.52 (s, 1H, 芳基 -H), 6.70 (s, 1H, 芳基 -H), 7.20 (s, 1H, 芳基 -H), 7.58 (s, 1H, 芳基 -H).

[0243]



[0244] 表 1:

[0245]

实施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	logP _a	
2	H	Me	Et	Me	H	3-CF ₃	5-Cl	2.21
3	H	Me	Et	Me	H	4-Cl	1.50	
4	H	Me	Et	Me	H	2-Cl	4-CF ₃	2.20
5	H	Me	Et	Me	H	3-Cl	1.58	
6	H	Me	Et	Me	Me	2-Cl	3-CF ₃	2.36
7	H	Me	iPr	Me	H	2-Cl	4-CF ₃	2.22
8	H	Me	Et	Me	Me	3-Cl	1.84	
9	H	Me	Et	Me	H	3-CF ₃	1.79	
10	H	Me	Et	Me	Me	3-CF ₃	1.86	
11	H	Me	Et	Me	Me	2-Cl	3-CF ₃	2.11
12	H	Me	iPr	Me	Me	2-Cl	4-CF ₃	2.52
13	H	Me	iPr	Me	Me	2-Cl	3-CF ₃	2.51
14	H	Me	Et	Me	Me	3-I	2.10	

[0246]

15	H	Me	Et	Me	Me	3-Me	4-(2-Cl-Ph)	2.58
16	H	Me	Et	Me	H	3-Me	4-(2-Cl-Ph)	2.39
17	H	Me	Et	Me	H	3-I	1.87	
18	H	Et	Et	Me	Me	2-Cl	4-CF ₃	2.59
19	H	Me	nPr	Me	Me	2-Cl	4-CF ₃	2.66
20	H	Me	iPr	Me	tBu	2-Cl	4-CF ₃	3.17
21	H	Me	iPr	Me	iPr	2-Cl	4-CF ₃	2.97
22	H	Me	Et	Me	tBu	2-Cl	4-CF ₃	2.83
23	H	Me	Et	Me	Me	2-Me	4-Cl	1.58
24	H	Me	Et	Me	iPr	2-Cl	4-CF ₃	2.87
25	H	Me	Et	Me	Me	2-Me	4-CF ₃	2.19
26	H	Me	Et	Me	Me	2-Cl	1.78	
27	H	Me	Et	Me	Me	4-CF ₃	1.96	
28	H	Me	Et	Me	Me	3-Cl	5-Cl	2.00
29	H	Me	nPr	Me	Me	3-Cl	5-Cl	2.22
30	H	Me	Et	Me	Me	2-nPr	4-nPr	2.97
31	H	Me	Et	Me	Me	4-CN	1.42	
32	H	Me	iPr	Me	Me	3-Cl	5-Cl	2.24
33	H	Me	Et	Me	Me	2-iPr	4-Cl	2.18
34	H	Me	iPr	Me	Me	2-iPr	4-Cl	2.34
35	H	Me	Et	Me	Me	3-CN	1.47	
36	H	Me	nPr	Me	Me	3-CN	1.63	
37	H	Me	烯丙基	Me	Me	3-CN	1.56	
38	H	-(CH ₂) ₅ -	Me	Me	3-CN	1.58		
39	H	-(CH ₂) ₄ -	Me	Me	3-CN	1.46		
40	H	-(CH ₂) ₅ -	Me	Me	2-Et	4-Cl	2.04	
41	H	-(CH ₂) ₄ -	Me	Me	2-Et	4-Cl	1.95	
42	H	Me	nPr	Me	Me	2-Et	4-Cl	2.00
43	H	Me	iPr	Me	Me	3-CF ₃	5-Cl	2.29
44	H	Me	Et	Me	Me	3-CF ₃	5-Cl	2.15
45	H	Me	Et	Me	Me	2-(4-Cl-Ph)	2.66	
46	H	-(CH ₂) ₄ -	Me	Me	2-Cl	1.81		
47	H	-(CH ₂) ₅ -	Me	Me	2-Cl	1.96		
48	H	Me	Et	Me	Me	2-Et	4-Cl	1.98
49	H	Me	Et	Me	Me	2-Cl	3-Me	2.01
50	H	-(CH ₂) ₅ -	Me	Me	2-Cl	3-Me	2.21	
51	H	Me	nPr	Me	Me	2-Cl	3-Me	2.17

52	H	-(CH ₂) ₄ -	Me	Me	2-Cl	3-Me	2.05	
53	H	-(CH ₂) ₅ -	Me	Me	2-iPr	4-Cl	2.34	
54	H	Me	nPr	Me	Me	2-iPr	4-Cl	2.35
55	H	-(CH ₂) ₄ -	Me	Me	2-iPr	4-Cl	2.22	
56	H	Me	Et	Me	Me	4-Cl	1.75	
57	H	Me	Et	Me	Me	2-Br	1.89	
58	H	Me	nPr	Me	Me	2-Br	2.04	
59	H	-(CH ₂) ₅ -	Me	Me	2-Br	2.06		
60	H	-(CH ₂) ₄ -	Me	Me	2-Br	1.90		
61	H	Me	Et	Me	Me	2-CF ₃	1.98	
62	H	Me	Et	Me	Me	2,3-F ₂ -4-CF ₃	2.31	
63	H	Me	nPr	Me	Me	2,3-F ₂ -4-CF ₃	2.48	

[0247] 制备实施例 64: N-乙基 -N-甲基 -N'-[4-(3-氯吡啶基 -5-氧基)-2,5-二甲苯基]甲脒 -通式 (I) 的化合物

[0248] 将 0.50 克 (2.19 毫摩尔) 4-(3-氯吡啶基 -5-氧基)-2,5-二甲代苯胺溶解在 10 毫升甲醇中,用 0.53 克 N-乙基 -N-甲基甲酰胺二甲基缩醛的甲醇溶液 (77%) 进行处理。将反应混合物在 45℃ 搅拌 12 小时,然后在真空下除去溶剂,得到 620 毫克产物 (产率 95%, 纯度 99%) ;log P(pH 2.3) = 1.70。

[0249] ¹H NMR δ (ppm) 1.19 (t, ³J_{HH} = 7Hz, 3H, CH₃), 2.10 (s, 3H, CH₃), 2.12 (s, 3H, CH₃), 2.48 (s, 3H, CH₃), 3.04 (s, 3H, NCH₃), 3.29 (q, ³J_{HH} = 7Hz, 2H, NCH₂), 6.77 (s, 1H, 芳基 -H), 7.14 (m, 1H, 芳基 -H), 7.21 (m, 1H, 芳基 -H), 7.94 (s, 1H, 芳基 -H), 8.12 (s, 1H, 芳基 -H), 没有检测到脒 -H。

[0250] 原料的制备:

[0251] 4-(3-氯吡啶基 -5-氧基)-2,5-二甲代苯胺 -通式 (VII) 的化合物

[0252] 将 2.7 克 (10.45 毫摩尔) 4-(3-氯吡啶基 -5-氧基)-2,5-二甲基硝基苯溶解在 10 毫升甲醇和 10 毫升浓盐酸中,然后加入 7.01 克 (31.36 毫摩尔) 氯化亚锡。将反应混合物回流 4 小时,冷却至室温,用二氯甲烷萃取 (2×50 毫升)。对合并的有机层进行干燥 (MgSO₄),过滤,蒸发至干燥,得到 2.2 克纯产物 (92%) ;log P(pH 2.3) = 1.83。

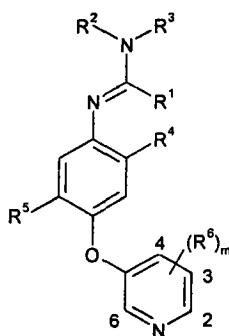
[0253] ¹H NMR δ (ppm) 2.15 (s, 3H, CH₃), 2.27 (s, 3H, CH₃), 2.58 (s, 3H, CH₃), 4.5 (b, 2H, NH₂), 6.90 (m, 1H, 芳基 -H), 7.32 (m, 1H, 芳基 -H), 7.49 (m, 1H, 芳基 -H), 7.55 (m, 1H, 芳基 -H), 8.27 (m, 1H, 芳基 -H)。

[0254] 4-(3-氯吡啶基 -5-氧基)-2,5-二甲基硝基苯 -通式 (IV) 的化合物

[0255] 将 2.00 克 (10.78 毫摩尔) 4-氯-2,5-二甲基硝基苯、1.29 克 (11.86 毫摩尔) 3-羟基 -6-甲基吡啶和 1.93 克 (14.01 毫摩尔) 碳酸钾悬浮在 10 毫升 DMF 中。将该反应混合物回流 2 小时,冷却至室温,用 100 毫升水和 50 毫升 2N 的氢氧化钠水溶液进行处理,用二氯甲烷进行萃取 (2×100 毫升)。对合并的有机萃取物进行干燥 (MgSO₄),过滤,蒸发至干燥。通过硅胶色谱,用环己烷 / 乙酸乙酯洗脱对粗产物进行纯化,得到标题化合物,产率为 94% (2.9 克,纯度 95%) ;log P(pH 2.3) = 3.61。

[0256] ¹H NMR δ (ppm) 2.30 (s, 3H, CH₃), 2.42 (s, 3H, CH₃), 2.58 (s, 3H, CH₃), 6.79 (m, 1H, 芳基 -H), 7.32 (m, 1H, 芳基 -H), 7.43 (m, 1H, 芳基 -H), 8.04 (m, 1H, 芳基 -H), 8.29 (m, 1H, 芳基 -H),

[0257]



[0258] 表 2:

[0259]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	logP _a
65	H	Me	Et	Me	Me	2-Me	0.60
66	H	Me	Et	Me	Me	6-Me	1.56
67	H	Me	Et	Me	Me	3-Cl	1.82

[0260] 制备实施例 68: N-乙基 -N-甲基 -N'-[4-(2-乙基 -3-氯吡啶基 -4-氧基)-2,5-二甲苯基]甲脒 -通式 (I) 的化合物

[0261] 将 0.20 克 (0.72 毫摩尔) 4-(2-乙基 -3-氯吡啶基 -4-氧基)-2,5-二甲代苯胺和 5 毫克对甲苯磺酸在 20 毫升原甲酸三甲酯中回流 3 小时。将该反应混合物冷却至室温,在真空下除去溶剂。将残余物溶解在 50 毫升二氯甲烷中,然后用 0.09 克 (1.45 毫摩尔) N-乙基 -N-甲基胺进行处理。在室温下搅拌 16 小时后,在真空下除去溶剂和未反应的胺,以极佳的产率和纯度得到产物 (240 毫克,产率 :99%,纯度 :98%) ;log P(pH 2.3) = 1.47。

[0262] ¹H NMR δ (ppm) 1.16 (t, ³J_{HH} = 7Hz, 3H, CH₃), 1.26 (t, ³J_{HH} = 7Hz, 3H, CH₃), 2.01 (s, 3H, CH₃), 2.17 (s, 3H, CH₃), 2.93 (q, ³J_{HH} = 7Hz, 2H, CH₂), 2.99 (s, 3H, NCH₃), 3.42 (q, ³J_{HH} = 7Hz, 2H, NCH₂), 6.40 (m, 1H, 吡啶 -H), 6.81 (s, 1H, Ph-H), 6.83 (s, 1H, Ph-H), 7.71 (s, 1H, 脒 -H), 8.22 (m, 1H, 吡啶 -H)。

[0263] 原料的制备 :

[0264] 4-(2-乙基 -3-氯吡啶基 -4-氧基)-2,5-二甲代苯胺 -通式 (VII) 的化合物

[0265] 在氩气氛下,将 3.11 克 (22.72 毫摩尔) 4-氨基 -2,5-二甲基苯酚、4.00 克 (22.72 毫摩尔) 3,4-二氯 -2-乙基吡啶和 5.02 克 (36.05 毫摩尔) 碳酸钾悬浮在 50 毫升 DMSO 中。将该反应混合物在 120℃ 搅拌 6 小时,冷却至室温,用 150 毫升水和 50 毫升 2N 的氢氧化钠水溶液进行处理,用二氯甲烷进行萃取 (2×100 毫升)。对合并的有机萃取物进行干燥 (MgSO₄),过滤,蒸发至干燥。通过硅胶色谱,用环己烷 / 乙酸乙酯洗脱对粗产物进行纯化,得到标题化合物,产率为 59% (3.7 克,纯度 97%) ;log P(pH 2.3) = 1.66。

[0266] ¹H NMR δ (ppm) 1.25 (t, ³J_{HH} = 7Hz, 3H, CH₃), 1.92 (s, 3H, CH₃), 2.03 (s, 3H, CH₃), 2.91 (q, ³J_{HH} = 7Hz, 2H, CH₂), 4.64 (s, 2H, NH₂), 6.37 (m, 1H, 吡啶 -H), 6.57 (s, 1H, Ph-H), 6.68 (s, 1H, Ph-H), 8.17 (m, 1H, 吡啶 -H)。

[0267]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	logP _a	
69	H	Me	Et	Me	Me	2-Cl	1.45	
70	H	-(CH ₂) ₅ ⁻	Me	Me	2-Cl	1.66		
71	H	-(CH ₂) ₄ ⁻	Me	Me	2-Cl	1.52		
72	H	Me	nPr	Me	Me	2-Cl	1.56	
73	H	Me	烯丙基	Me	Me	2-Et	3-Cl	1.51
74	H	Me	nPr	Me	Me	2-Et	3-Cl	1.59
75	H	-(CH ₂) ₅ ⁻	Me	Me	2-Et	3-Cl	1.56	
76	H	-(CH ₂) ₄ ⁻	Me	Me	2-Et	3-Cl	1.43	
77	H	Me	Et	Me	Me	2-CF ₃	1.75	
78	H	Me	nPr	Me	Me	2-CF ₃	1.75	
79	H	-(CH ₂) ₅ ⁻	Me	Me	2-CF ₃	1.78		
80	H	-(CH ₂) ₄ ⁻	Me	Me	2-CF ₃	1.69		
81	H	Me	烯丙基	Me	Me	2-Cl	1.74	

[0270] 药效实施例 A:小麦隐匿柄锈菌 (*Puccinia recondita* f. Sp. Tritici) (小麦褐锈病) 的体内预防性测试

[0271] 溶剂:50 重量份 N, N- 二甲基乙酰胺

[0272] 乳化剂 :1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0273] 为了制备活性化合物的合适制剂,将 1 重量份活性化合物与一定量的溶剂和乳化剂混合,用水稀释该浓缩物至所需浓度。

[0274] 为了测试预防性活性,用小麦隐匿柄锈菌的孢子悬浮液(浓度为 0.1%的水性琼脂溶液)对树苗进行接种。在喷洒的涂层干燥后,用活性化合物制剂以一定的施用率喷洒植物。将所述植物在 20℃、相对大气湿度为 100%的培养箱中放置 24 小时。

[0275] 将所述植物放置在约 20℃、相对大气湿度约 80%的温室中,以促进锈脓包(rust pustule)的生长。

[0276] 在培养后 10 天,对测试结果进行评价。0%表示相当于对照样的药效,100%的药效表示无病症出现。

[0277] 在该测试中,依据本发明的以下化合物在活性成分浓度为 1000ppm 的情况下表现出等于或高于 70%的药效:1;3;4;5;6;7;9;10;11;12;13;14;18;19;23;26;27;28;29;32;33;34;35;42;43;44;47;50;57;58;59;60;61;64;66;68;69;70;71;74;75;76;81。

[0278] 药效实施例 B:禾白粉菌(Erysiphe graminis)(大麦白粉病)的体内预防性测试

[0279] 溶剂:50 重量份 N,N-二甲基乙酰胺

[0280] 乳化剂:1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0281] 为了制备活性化合物的合适制剂,将 1 重量份活性化合物或活性化合物组合物与一定量的溶剂和乳化剂混合,用水稀释该浓缩物至所需浓度。

[0282] 为了测试预防性活性,以一定的施用率将活性化合物或活性化合物组合物的制剂品喷洒到树苗上。

[0283] 在喷洒的涂层干燥后,将禾白粉菌(Erysiphe graminis f.sp.hordei)的孢子撒在所述植物上。

[0284] 将所述植物放置在约 20℃,相对大气湿度约为 80%的温室中,以促进霉脓疱的生长。

[0285] 在接种后 7 天,对测试结果进行评价。0%表示相当于对照样的药效,100%的药效表示无病症出现。

[0286] 在该测试中,依据本发明的以下化合物在活性成分浓度为 1000ppm 的情况下表现出等于或高于 70%的药效:1;3;4;6;7;10;11;12;14;18;19;23;26;27;28;29;33;34;35;42;43;44;47;64;66;68;69;70;72;74;75;76。

[0287] 药效实施例 C:茄链格孢(Alternaria solani)(番茄叶斑病)的体内保护性测试

[0288] 溶剂:49 重量份 N,N-二甲基甲酰胺

[0289] 乳化剂:1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0290] 为了制备活性化合物的合适制剂,将 1 重量份活性化合物与一定量的溶剂和乳化剂混合,用水稀释该浓缩物至所需浓度。

[0291] 为了测试保护性活性,以一定的施用率将活性化合物的制剂喷洒到树苗上。在喷洒的涂层干燥后,用茄链格孢的水性孢子悬浮液接种所述植物。将所述植物在约 20℃、相对大气湿度 100%的培养箱中保持一天。然后将所述植物放置在约 20℃、相对大气湿度 96%的培养箱中。

[0292] 在接种后 7 天对测试结果进行评价。0%表示相当于对照样的药效,100%的药效表示无病症出现。

[0293] 在该测试中,依据本发明的以下化合物在活性成分浓度为 500ppm 的情况下表现出等于或高于 70%的药效:1;6;12;23;48;69。

[0294] 药效实施例 D:白叉丝单囊壳 (*Podosphaera leucotricha*) (苹果) 的体内保护性测试

[0295] 溶剂:24.5 重量份丙酮

[0296] 24.5 重量份二甲基乙酰胺

[0297] 乳化剂:1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0298] 为了制备活性化合物的合适制剂,将 1 重量份活性化合物与一定量的溶剂和乳化剂混合,用水稀释该浓缩物至所需浓度。

[0299] 为了测试保护性活性,以一定的施用率将活性化合物的制剂喷洒到树苗上。在喷洒的涂层干燥后,用苹果霉病(白叉丝单囊壳)的致病剂(causal agent)的水性孢子悬浮液接种所述植物。然后将所述植物放置在约 23℃、相对大气湿度 70%的温室中。

[0300] 在接种后 10 天对测试结果进行评价。0%表示相当于对照样的药效,100%的药效表示无病症出现。

[0301] 在该测试中,依据本发明的以下化合物在活性成分浓度为 100ppm 的情况下表现出等于或高于 70%的药效:1;6;12;13;23;28;34;66;69;73;74。

[0302] 药效实施例 E:苍耳单丝壳 (*Sphaerotheca fuliginea*) (黄瓜) 的体内保护性测试

[0303] 溶剂:24.5 重量份丙酮

[0304] 24.5 重量份二甲基乙酰胺

[0305] 乳化剂:1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0306] 为了制备活性化合物的合适制剂,将 1 重量份活性化合物与一定量的溶剂和乳化剂混合,用水稀释该浓缩物至所需浓度。

[0307] 为了测试保护性活性,以一定的施用率将活性化合物的制剂喷洒到树苗上。在喷洒的涂层干燥后,用苍耳单丝壳的水性孢子悬浮液接种所述植物。然后将所述植物放置在约 23℃、相对大气湿度 70%的温室中。

[0308] 在接种后 7 天对测试结果进行评价。0%表示相当于对照样的药效,100%的药效表示无病症出现。

[0309] 在该测试中,依据本发明的以下化合物在活性成分浓度为 100ppm 的情况下表现出等于或高于 70%的药效:1;6;12;13;21;22;23;26;28;33;34;42;48;54;55;57;66;68;69;73;74;75。

[0310] 药效实施例 F:疣顶单胞锈菌 (*Uromyces appendiculatus*) (豆类) 的体内保护性测试

[0311] 溶剂:24.5 重量份丙酮

[0312] 24.5 重量份二甲基乙酰胺

[0313] 乳化剂:1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0314] 为了制备活性化合物的合适制剂,将 1 重量份活性化合物与一定量的溶剂和乳化

剂混合,用水稀释该浓缩物至所需浓度。

[0315] 为了测试保护性活性,以一定的施用率将活性化合物的制剂喷洒到树苗上。在喷洒的涂层干燥后,用豆类锈病(疣顶单胞锈菌)的致病菌的水性孢子悬浮液接种所述植物,然后将所述植物在约 20℃、相对大气湿度为 100%的培养箱中放置 1 天。

[0316] 然后将所述植物放置在约 21℃、相对大气湿度 90%的温室中。

[0317] 在接种后 10 天对测试结果进行评价。0%表示相当于对照样的药效,100%的药效表示无病症出现。

[0318] 在该测试中,依据本发明的以下化合物在活性成分浓度为 10ppm 的情况下表现出等于或高于 70%的药效:48 ;50 ;54 ;55 ;57。