



(12) 发明专利申请



(10) 申请公布号 CN 118666830 A

(43) 申请公布日 2024. 09. 20

(21) 申请号 202410788840.2

(22) 申请日 2024.06.19

(71) 申请人 南开大学

地址 300071 天津市南开区卫津路94号

(72) 发明人 范志金 高卫 李静 袁昊林
李坤 张越 张金 陈来 韩宁
唐良富

(51) Int. Cl.

C07D 417/04 (2006.01)

C07D 417/14 (2006.01)

A01N 43/824 (2006.01)

A01N 43/828 (2006.01)

A01P 1/00 (2006.01)

A01P 3/00 (2006.01)

A01P 7/02 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

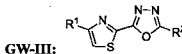
权利要求书2页 说明书17页

(54) 发明名称

一类含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物及其制备方法 and 用途

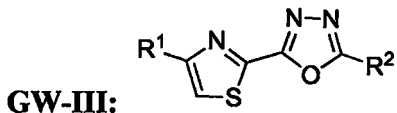
(57) 摘要

本发明提供了一类含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物及其制备方法和用途,具体涉及一类衍生物,其化学结构通式见式GW-III:



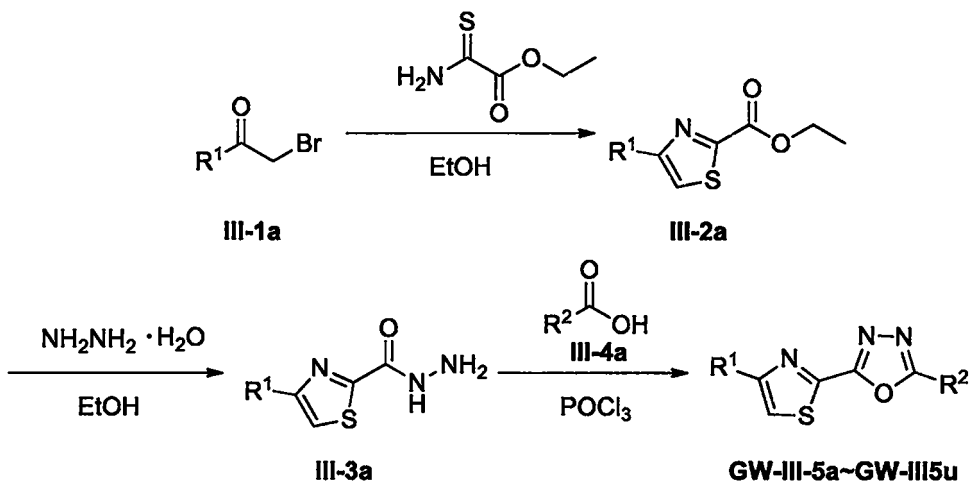
本发明公开了上述化合物的结构通式、合成方法与用作杀虫剂、杀菌剂、抗植物病毒剂的用途,其与农业上可接受的助剂或增效剂以及与商品杀虫剂、杀菌剂、抗植物病毒剂、杀螨剂组合使用在防治农业、林业、园艺植物虫害、病害、病毒病害中的用途和制备方法。

1. 一类含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物,具有如式GW-III所示的化学结构通式:



其中, R^1 选自: 苯基、环丙基、异丙基、三氟甲基、噻吩-2-基、3,4-二氯异噻唑-5-基; R^2 选自: 4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-基、3,4-二氯异噻唑-5-基、呋喃-2-基、环丙基、2-氟苯基、三氟甲基、三氯甲基、3-甲基异噻唑-4基。

2. 根据权利要求1所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III的具体合成路线如下:



化合物 GW-III 的合成路线

根据权利要求1所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III的合成方法如下:

A. 化合物III-2a的制备:

在200毫升圆底烧瓶中加入硫代草酰胺乙酯12毫摩尔,溶于40毫升无水乙醇,于室温搅拌状态下滴加化合物III-1a (10毫摩尔),滴加完毕,反应体系转移至油浴加热至80摄氏度,回流反应2-4小时,TLC进行监测,反应完全后将反应溶剂旋除,加适量乙酸乙酯溶解,用饱和氯化钠溶液洗涤2次,有机层用无水硫酸钠干燥。减压抽滤后残余物使用沸程60~90摄氏度的石油醚/乙酸乙酯,体积比为3:1~5:1,v/v的洗脱剂,经100~200目硅胶柱层析纯化得到中间体III-2a;

B. 化合物III-3a的制备:

在200毫升圆底烧瓶中加入化合物III-2a 10毫摩尔,溶于40毫升无水乙醇,于室温搅拌状态下滴加80%水合肼12毫摩尔,滴加完毕,反应体系转移至油浴加热至80摄氏度,回流反应2-4小时,TLC进行监测,反应完全以后冷却至室温继续搅拌反应1-2小时,得到大量固体,减压抽滤得到固体中间体III-3a;

C. 化合物GW-III-5a~GW-III-5u的制备:

在50毫升圆底烧瓶中加入化合物III-3a 1毫摩尔和取代羧酸III-4a 1.1毫摩尔,滴加8毫升三氯氧磷,将反应体系转移至油浴加热至100摄氏度,反应3h,反应结束,将反应体系冷却至室温后逐滴加入到200毫升冰水中淬灭反应,搅拌状态下逐滴加入饱和碳酸氢钠溶液调节pH至7-8时有大量气泡生成,之后水相用乙酸乙酯萃取2次,即50毫升×2,合并有机层用饱和氯化钠溶液洗涤2次,合并有机层用无水硫酸钠干燥,减压抽滤后残余物使用沸程60~90摄氏度的石油醚/乙酸乙酯,其体积比为1:1~3:1,v/v的为洗脱剂,经100~200目硅

胶柱层析纯化得到目标化合物GW-III-5a~GW-III-5u。

3. 权利要求1所述的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物在制备农用杀真菌剂中的用途,所述杀真菌剂防治的真菌为番茄早疫病菌、黄瓜灰霉病菌、花生褐斑病菌、小麦赤霉病菌、苹果轮纹病菌、水稻纹枯病菌、油菜菌核病菌。

4. 一种农用杀菌组合物,该组合物包含权利要求1所述的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物作为活性成分;该组合物包含0.1%到99.9%重量的活性成分,99.9%到0.1%重量的固体或液体助剂,以及选自0到25%重量的表面活性剂。

5. 一种农用杀菌复配组合物,其包含权利要求1所述的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物和其他商品杀菌剂复配作为活性成分;活性成分含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物与其他商品杀菌剂的质量百分比为1%:99%到99%:1%,该复配组合物包含1%到99%重量的活性成分,99%到1%重量的固体或液体助剂,以及选自0到25%重量的表面活性剂。

6. 一种农用杀虫、杀螨复配组合物,其包含权利要求1所述的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物和其他商品杀虫、杀螨剂复配作为活性成分;活性成分含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物与其他商品杀虫、杀螨剂的质量百分比为1%:99%到99%:1%,该复配组合物包含1%到99%重量的活性成分,99%到1%重量的固体或液体助剂,及选自0到25%重量的表面活性剂。

7. 一种抗植物病毒剂复配组合物,其包含权利要求1所述的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物和其他商品抗植物病毒剂复配作为活性成分;活性成分含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物与其他商品抗植物病毒剂的质量百分比为1%:99%到99%:1%,该复配组合物包含1%到99%重量的活性成分,99%到1%重量的固体或液体助剂,及选自0到25%重量的表面活性剂。

8. 一种植物激活剂复配组合物,其包含权利要求1所述的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物和其他商品植物激活剂复配作为活性成分;活性成分含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物与其他商品植物激活剂的质量百分比为1%:99%到99%:1%,该复配组合物包含1%到99%重量的活性成分,99%到1%重量的固体或液体助剂,及选自0到25%重量的表面活性剂。

一类含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物及其制备方法和用途

技术领域

[0001] 本发明的技术方案属于农药领域,具体涉及含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物及其制备方法和用途。

背景技术

[0002] 农药是重要的农业生产资料,为保障农业生产、农产品质量和生态环境安全发挥着重要作用。然而,长期使用现有少量作用模式的化学农药以及全新作用机制农药品种开发进程缓慢,造成了严重的农药抗药性问题;同时环境保护法律法规的加强以及对农药安全性要求的提高,使得新型农药创制面临巨大挑战。

[0003] 计算机辅助药物设计在农药研发中起着非常重要的作用(Vucicevic J, et al. Current Medicinal Chemistry, 2019, 26 (21): 3874-3889.)。分子对接(Molecular docking)是基于受体的虚拟筛选的主要方法,已广泛用于研究农药分子与靶标蛋白的结合模式和虚拟筛选化合物数据库获得苗头化合物,其研究原理就是将抑制剂小分子置于受体蛋白活性口袋内,然后根据受体与小分子的几何、能量和化学环境相匹配的原则来评价其结合情况,并确定其最佳的结合模式。丙酮酸激酶作为新颖的潜在杀菌剂靶标,对新农药尤其是新杀菌剂的创制具有重大意义,可为新农药创制研究提供新的选择和可行性方案(Fan ZJ, et al. Journal of Agricultural and Food Chemistry, 2010, 58(5): 2630-2636; Zhao B, et al. Journal of Agricultural and Food Chemistry, 2018, 66(46): 12439-12452.)。1,3,4-噁二唑(1,3,4-oxadiazole),是含O和N原子的五元杂环,因其具有良好生物和生理活性而使它在新型药物创制中发挥越来越重要的作用,将1,3,4-噁二唑引入不同的化合物结构中能生成一系列具有广谱生物活性的化合物(Dong JY, et al. Journal of Agricultural and Food Chemistry, 2022, 70(11): 3435-3446; Alam MM, et al. New Journal of Chemistry, 2023, 47(10): 5021-5032.)。

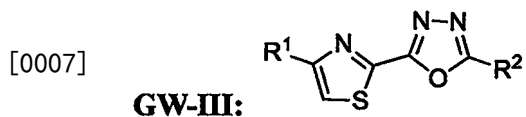
[0004] 本系列化合物基于潜在丙酮酸激酶抑制剂YZK-C22的核心“5并5”稠杂环骨架“1,2,4-三唑[3,4-b]-1,3,4-噻二唑”衍生设计了“5联5”的双杂环为核心骨架的1,3,4-噁二唑联噻唑系列衍生物,辅之分子对接技术,确定优先合成的目标分子,结合试验过程中发现的构效关系,指导设计合成杀菌活性更佳的目标化合物,最终得到了一类1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物,并进行了系统的生物活性的筛选和评价。

发明内容

[0005] 本发明所要解决的技术问题是:提供一类新的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物的合成方法,提供这类化合物调控农业、园艺和卫生以及林业植物害虫和植物病原物的生物活性及其测定方法,同时提供这些化合物在农业领域、园艺领域、林业领域以及卫生领域中的应用。

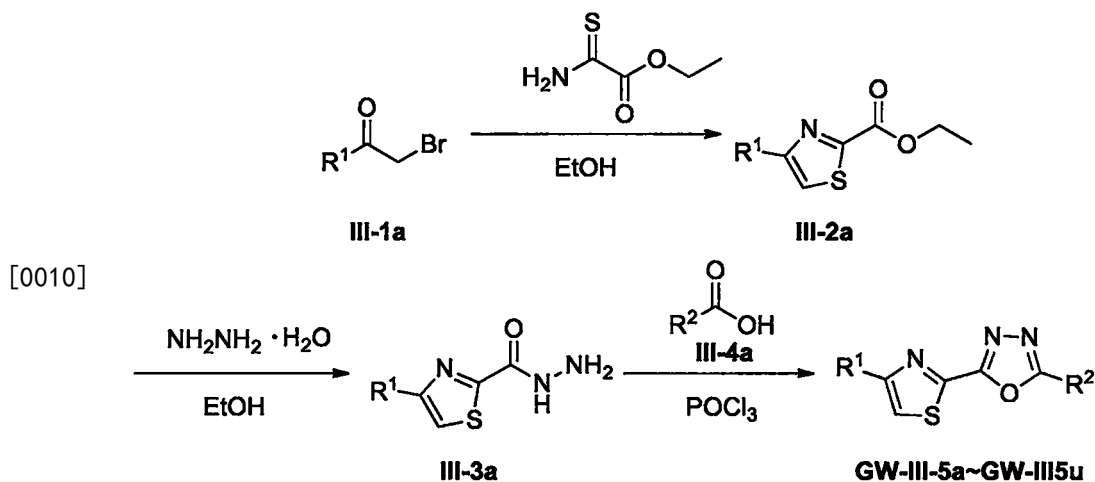
[0006] 本发明解决该技术问题所采用的技术方案是:具有农业领域、园艺领域、林业领域杀虫、杀螨活性、杀菌活性、抗植物病毒活性、诱导植物产生抗病活性的1,3,4-噁二唑联噻

唑衍生物的化学结构通式如GW-III所示：



[0008] 其中, R^1 选自: 苯基、环丙基、异丙基、三氟甲基、噻吩-2-基、3,4-二氯异噻唑-5-基; R^2 选自: 4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-基、3,4-二氯异噻唑-5-基、呋喃-2-基、环丙基、2-氟苯基、三氟甲基、三氯甲基、3-甲基异噻唑-4基;

[0009] 本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III及其中间体的合成路线如下：



[0011] 本发明所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III的合成方法分为以下步骤：

[0012] A. 化合物III-2a的制备：

[0013] 在200毫升圆底烧瓶中加入硫代草酰胺乙酯12毫摩尔,溶于40毫升无水乙醇,于室温搅拌状态下滴加化合物III-1a (10毫摩尔),滴加完毕,反应体系转移至油浴加热至80摄氏度,回流反应2-4小时,TLC进行监测,反应完全后将反应溶剂旋除,加适量乙酸乙酯溶解,用饱和氯化钠溶液洗涤2次,有机层用无水硫酸钠干燥。减压抽滤后残余物使用沸程60~90摄氏度的石油醚/乙酸乙酯,体积比为3:1~5:1,v/v的洗脱剂,经100~200目硅胶柱层析纯化得到中间体III-2a;

[0014] B. 化合物III-3a的制备：

[0015] 在200毫升圆底烧瓶中加入化合物III-2a 10毫摩尔,溶于40毫升无水乙醇,于室温搅拌状态下滴加80%水合肼12毫摩尔,滴加完毕,反应体系转移至油浴加热至80摄氏度,回流反应2-4小时,TLC进行监测,反应完全以后冷却至室温继续搅拌反应1-2小时,得到大量固体,减压抽滤得到固体中间体III-3a;

[0016] C. 化合物GW-III-5a~GW-III-5u的制备：

[0017] 在50毫升圆底烧瓶中加入化合物III-3a 1毫摩尔和取代羧酸III-4a 1.1毫摩尔,滴加8毫升三氯氧磷,将反应体系转移至油浴加热至100摄氏度,反应3h,反应结束,将反应体系冷却至室温后逐滴加入到200毫升冰水中淬灭反应,搅拌状态下逐滴加入饱和碳酸氢钠溶液调节pH至7-8时有大量气泡生成,之后水相用乙酸乙酯萃取2次,即50毫升×2,合并有机层用饱和氯化钠溶液洗涤2次,合并有机层用无水硫酸钠干燥,减压抽滤后残余物使用沸程60~90摄氏度的石油醚/乙酸乙酯,其体积比为1:1~3:1,v/v的为洗脱剂,经100~200

目硅胶柱层析纯化得到目标化合物GW-III-5a~GW-III-5u。

[0018] D.含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III的用途:

[0019] 本发明提供了含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III在制备杀虫剂中的用途。

[0020] 本发明提供了含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III在制备杀螨剂中的用途。

[0021] 本发明提供了含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III在制备杀真菌剂中的用途。

[0022] 本发明提供了含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III在制备抗烟草花叶病毒剂中的用途。

[0023] 本发明提供了含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III在制备植物激活剂用于诱导烟草抗烟草花叶病毒中的用途。

[0024] 具体为:

[0025] 本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物在制备农用杀真菌剂中的用途,所述杀真菌剂防治的真菌为番茄早疫病菌、黄瓜灰霉病菌、花生褐斑病菌、小麦赤霉病菌、苹果轮纹病菌、水稻纹枯病菌、油菜菌核病菌。

[0026] 一种农用杀菌组合物,该组合物包含本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III作为活性成分;该组合物包含0.1%到99.9%重量的活性成分,99.9%到0.1%重量的固体或液体助剂,以及选自0到25%重量的表面活性剂。

[0027] 一种农用杀菌复配组合物,其包含本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III和其他商品杀菌剂复配作为活性成分;活性成分含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与其他商品杀菌剂的质量百分比为1%:99%到99%:1%,该复配组合物包含1%到99%重量的活性成分,99%到1%重量的固体或液体助剂,以及选自0到25%重量的表面活性剂。

[0028] 一种农用杀虫、杀螨复配组合物,其包含本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III和其他商品杀虫、杀螨剂复配作为活性成分;活性成分含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与其他商品杀虫、杀螨剂的质量百分比为1%:99%到99%:1%,该复配组合物包含1%到99%重量的活性成分,99%到1%重量的固体或液体助剂,及选自0到25%重量的表面活性剂。

[0029] 本发明提供了含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III适用于防治农业和林业以及园艺植物的虫害和病原物以及诱导植物产生对植物虫害和病原物的防御能力,上述农药组合物包括农用杀菌组合物、农用杀虫组合物、农用抗植物病毒组合物、农用植物激活剂组合物,所述组合物包含本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III作为活性成分;该组合物包含0.1%到99.9%重量的活性成分,99.9%到0.1%重量的固体或液体助剂,以及选自0到25%重量的表面活性剂。

[0030] E.含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III的组合物及其用途:

[0031] 含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与商品农药共同形成一种农用组合物施用;所述商品农药选自:杀虫剂、杀菌剂、抗植物病毒剂、杀螨剂、植物激活剂中的一种或几种。该组合物含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III和其他商品杀虫剂、杀菌剂、抗植物病毒剂、杀螨剂、植物激活剂复配作为活性成分;该组合物活性成分的含量为1%:99%到99%:1%重量,该复配组合物包含1%到99%重量的活性成分,99%到1%重量的固体或液体助剂,以及选自0到25%重量的表面活性剂。具体的组合情况如下:

[0032] 所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与所述杀虫剂中的任意一种或两种组

合形成杀虫组合物用于防治农业和林业以及园艺植物虫害；

[0033] 所述杀虫剂选自：烯虫酯、地亚啉、啉虫脒、甲氨基阿维菌素、弥拜菌素、阿维菌素、多杀菌素、七氟甲醚菊酯、氯氟醚菊酯、高效氯氰菊酯、高效氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯、溴氰菊酯、甲氰菊酯、 β -氟氯氰菊酯、 λ -三氟氯氰菊酯、二氯苯醚菊酯、苄氯菊酯、丙烯菊酯、联苯菊酯、氯菊酯、醚菊酯、氟氯苯菊酯、氯氟胺氰戊菊酯、吡虫啉、烯啶虫胺、氯噻啉、噻虫啉、噻虫嗪、噻虫胺、呋虫胺、可尼丁、达特南、除虫脲、灭幼脲、伏虫隆、除虫隆、氟铃脲、氟虫脲、啉虫隆、虱螨脲、毒虫脲、氟幼脲、多氟脲、氟螨脲、双苯氟脲、氟啉脲、噻虫脲、双三氟虫脲、呋喃虫酰肼、虫酰肼、氯虫酰肼、甲氧虫酰肼、环虫酰肼、敌敌畏、啶硫磷、啉啉硫磷、叶蝉散、西维因、抗蚜威、速灭威、异丙威、杀螟丹、仲丁威、叶飞散、甲萘威、杀螟丹、溴螨酯、噻螨酮、唑螨酯、啉螨酮、四螨嗪、炔螨特、丁醚脲、吡蚜酮、螺螨酯、螺虫酯、螺虫乙酯、三唑锡、噻嗪酮、杀虫单、杀虫双、氯虫酰胺、四氯虫酰胺、氟虫酰胺、氟氰虫酰胺、氰虫酰胺、丁烯氟虫腈、啉虫酰胺、溴虫腈、吡啉酮、乙螨唑、吡螨胺、啉幼酮、吡丙醚、埃玛菌素、戊吡虫胍；

[0034] 所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III在所述杀虫组合物中的质量百分含量是1%-90%；优选地，所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与所述杀虫剂的比例为质量百分比1%:99%到99%:1%；

[0035] 所述杀虫组合物加工的剂型选自：种子处理乳剂、水乳剂、微乳剂、悬乳剂、胶囊悬浮剂、水溶性粒剂、细粒剂、可溶性浓剂、毒谷、块状毒饵、粒状毒饵、片状毒饵、浓毒饵、缓释块、静电喷雾剂、水包油乳剂、烟雾罐、烟雾烛、烟雾筒、烟雾棒、烟雾片、烟雾丸、发气剂、油膏、热雾剂、冷雾剂、气雾剂、固/液混合装剂、液/液混合装剂、固/固混合装剂、药漆、微粒剂、追踪粉剂、油悬剂、油分散性粉剂、浓胶剂、泼浇剂、种衣剂、涂抹剂、成膜油剂、超低容量液剂、蒸汽释放剂；

[0036] 所述杀虫组合物防治的植物虫害选自：草地贪夜蛾、红蜘蛛、东亚飞蝗、云斑车蝗、中华稻蝗、日本黄脊蝗、单刺蝼蛄、东方蝼蛄、稻蓟马、烟蓟马、温室蓟马、稻管蓟马、麦筒管蓟马、温室白粉虱、烟粉虱、黑尾叶蝉、大青叶蝉、棉叶蝉、斑衣蜡蝉、褐飞虱、白背飞虱、灰飞虱、甘蔗扁角飞虱、棉蚜、麦二叉蚜、麦长管蚜、桃蚜、高粱蚜、萝卜蚜、吹绵蚧、桑盾蚧、矢尖盾蚧、梨圆蚧、白蜡虫、红蜡蚧、朝鲜球坚蚧、梨网蝽、香蕉网蝽、细角花蝽、微小花蝽、针缘蝽、稻蛛缘蝽、稻褐蝽、稻黑蝽、稻绿蝽、绿盲蝽、苜蓿盲蝽、中黑盲蝽、大草蛉、丽草蛉、中华草蛉、谷蛾、衣蛾、黄刺蛾、褐刺蛾、扁刺蛾、麦蛾、棉红铃虫、甘薯麦蛾、小菜蛾、桃小食心虫、大豆食心虫、桃小食心虫、苹果顶梢卷叶蛾、褐带长卷叶蛾、拟小黄卷叶蛾、二化螟、豆荚螟、玉米螟、三化螟、菜螟、稻纵卷叶螟、条螟、棉卷叶野螟、桃蛀螟、黏虫、斜纹夜蛾、稻螟蛉、棉小造桥虫、甜菜夜蛾、大螟、棉铃虫、鼎点金刚钻、小地老虎、大地老虎、黄地老虎、盗毒蛾、舞毒蛾、甘薯天蛾、豆天蛾、直纹稻弄蝶、隐纹谷弄蝶、柑橘凤蝶、玉带凤蝶、菜粉蝶、苜蓿赤蛱蝶、苜蓿黄蛱蝶、豆芫菁、金星步甲、皱鞘步甲、麦穗步甲、沟金针虫、细胸金针虫、谷斑皮蠹、黑皮蠹、柑橘小吉丁虫、金缘吉丁虫、黄粉虫、黑粉虫、赤拟谷盗、杂拟谷盗、铜绿异丽金龟、暗黑金龟、华北大黑鳃金龟、桑天牛、星天牛、橘褐天牛、桃红颈天牛、大猿叶虫、小猿叶虫、黄守瓜、黄曲条跳甲、绿豆象、豌豆象、蚕豆象、玉米象、米象、小麦叶蜂、梨实蜂、黄带姬蜂、黏虫白星姬蜂、螟蛉悬茧姬蜂、棉铃虫齿唇姬蜂、螟黑点疣姬蜂、蚊、蝇、虻、麦红吸浆虫、麦黄吸浆虫、稻瘿蚊、柑橘大实蝇、瓜实蝇、麦叶灰潜蝇、美洲斑潜蝇、豆秆黑潜蝇、麦秆蝇、种蝇、葱蝇、萝卜蝇、伞裙追寄蝇、玉米螟厉寄蝇、黏虫；

[0037] 所述杀虫组合物防治的植物选自：稻谷、小麦、大麦、燕麦、玉米、高粱、甘薯、马铃薯、木薯、大豆、荷兰豆、蚕豆、豌豆、绿豆、小豆、棉花、蚕桑、花生、油菜、芝麻、向日葵、甜菜、甘蔗、咖啡、可可、人参、贝母、橡胶、椰子、油棕、剑麻、烟草、番茄、辣椒、萝卜、黄瓜、白菜、芹菜、榨菜、甜菜、油菜、葱、大蒜、西瓜、甜瓜、哈密瓜、木瓜、苹果、柑桔和桃树、茶、山野菜、竹笋、啤酒花、胡椒、香蕉、番木瓜、兰花、盆景。

[0038] 所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与所述杀菌剂中的任意一种或两种组合形成杀菌组合物用于防治农业和林业以及园艺植物病害；

[0039] 所述杀菌剂选自：苯并噻二唑、噻酰菌胺、甲噻诱胺、DL- β -氨基丁酸、异噻菌胺、病毒唑、安托芬、宁南霉素或水杨酸、霜脲氰、福美双、福美锌、代森锰锌、乙磷铝、甲基硫菌灵、百菌清、敌可松、腐霉利、苯锈啉、甲基托布津、托布津、精甲霜灵、氟吗啉、烯酰吗啉、高效甲霜灵、高效苯霜灵、双氯氰菌胺、磺菌胺、甲磺菌胺、噻氟菌胺、叶枯酞、环丙酰菌胺、环氟菌胺、环酰菌胺、氰菌胺、硅噻菌胺、萎锈灵、氧化萎锈灵、麦锈灵、甲呋酰胺、灭锈胺、氟酰胺、呋吡菌胺、噻呋酰胺、啉酰菌胺、吡噻菌胺、吡唑萆菌胺、联苯吡菌胺、氟吡菌酰胺、氟唑环菌胺、氟唑菌酰胺、氟唑菌苯胺、苯丙烯氟菌唑、异丙噻菌胺、氟唑菌酰羟胺、氟苯醚酰胺、氟醚菌酰胺、双炔酰菌胺、苯酰菌胺、乙菌利、异菌脲、嘧菌酯、醚菌胺、氟嘧菌酯、醚菌酯、苯氧菌胺、肟醚菌胺、啉氧菌酯、唑菌胺酯、肟菌酯、烯肟菌酯、烯肟菌胺、氧环唑、糠菌唑、环丙唑醇、苯醚甲环唑、烯唑醇、高效烯唑醇、氟环唑、腈苯唑、氟唑唑、氟硅唑、粉唑醇、己唑醇、亚胺唑、种菌唑、叶菌唑、腈菌唑、戊菌唑、丙环唑、丙硫菌唑、硅氟唑、戊唑醇、四氟醚唑、三唑醇、灭菌唑、联苯三唑醇、噻菌灵、麦穗宁、抑霉唑、高效抑霉唑、咪鲜胺、氟菌唑、氰霜唑、咪唑菌酮、噁咪唑、稻瘟酯、噁唑菌酮、啉菌噁唑、噁霉灵、噁霜灵、噻唑菌胺、土菌灵、辛噻酮、苯噻硫氰、十二环吗啉、丁苯吗啉、十三吗啉、拌种咯、咯菌腈、氟啉胺、啉斑肟、环啉菌胺、氟啉酰菌胺、啉菌胺、嘧菌环胺、氟嘧菌胺、噻呋酰胺、嘧菌胺、嘧霉胺、氯苯嘧啶醇、氟苯嘧啶醇、灭螨猛、二氰蒽醌、乙氧喹啉、羟基喹啉、丙氧喹啉、苯氧喹啉、乙霉威、异丙菌胺、苯噻菌胺、霜霉威、磺菌威、敌瘟磷、异稻瘟净、吡菌磷、甲基立枯磷、灭瘟素、春雷霉素、多抗霉素、多氧霉素、有效霉素、井冈霉素、链霉素、甲霜灵、呋霜灵、苯霜灵、呋酰胺、多菌灵、苯菌灵、甲基硫菌灵、三唑酮、乙嘧酚磺酸酯、二甲嘧酚、乙嘧酚、敌菌丹、克菌丹、灭菌丹、乙烯菌核利、氟氯菌核利、菌核净、百菌清、稻瘟灵、稻瘟净、叶枯唑、五氯硝基苯、丙森锌、三乙膦酸铝、硫磺、波尔多液、硫酸铜、氧氯化铜、氧化亚铜、氢氧化铜、苯菌酮、戊菌隆、啉菌酮、四氯苯酞、咯嗪酮、螺环菌胺、三环唑、噻胺灵、多果啉、双胍辛盐、双胍辛胺、氯硝胺、苯磺菌胺、甲苯磺菌胺、吡啉酯、敌磺钠、唑菌酮、烯丙苯噻唑、溴硝醇、碘甲烷、威百亩、敌线酯、棉隆、二氯异丙醚、噻唑磷、丰索磷、虫线磷、除线磷、杀线威、硫酰氟、二氯丙烯、二氯异烟酸、烯丙异噻唑；

[0040] 所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III在所述杀菌组合物中总的质量百分含量是1%-90%；所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与所述杀菌剂的比例为质量百分比1%:99%到99%:1%；

[0041] 所述杀菌组合物加工的剂型选自：种子处理乳剂、水乳剂、微乳剂、悬乳剂、胶囊悬浮剂、水溶性粒剂、细粒剂、可溶性浓剂、毒谷、块状毒饵、粒状毒饵、片状毒饵、浓毒饵、缓释块、静电喷雾剂、水包油乳剂、烟雾罐、烟雾烛、烟雾筒、烟雾棒、烟雾片、烟雾丸、发气剂、油膏、热雾剂、冷雾剂、气雾剂、固/液混合装剂、液/液混合装剂、固/固混合装剂、药漆、微粒

剂、追踪粉剂、油悬剂、油分散性粉剂、浓胶剂、泼浇剂、种衣剂、涂抹剂、成膜油剂、超低容量液剂、蒸汽释放剂；

[0042] 所述杀菌组合物防治的植物病害选自：稻苗绵腐病、番茄根腐病、马铃薯晚疫病、烟草黑胫病、谷子白粉病、葡萄霜霉病、莴苣霜霉病、黄瓜霜霉病、黄瓜炭疽病；

[0043] 所述杀菌组合物适用的植物选自：稻谷、小麦、大麦、燕麦、玉米、高粱、甘薯、马铃薯、木薯、大豆、荷兰豆、蚕豆、豌豆、绿豆、小豆、棉花、蚕桑、花生、油菜、芝麻、向日葵、甜菜、甘蔗、咖啡、可可、人参、贝母、橡胶、椰子、油棕、剑麻、烟草、番茄、辣椒、萝卜、黄瓜、白菜、芹菜、榨菜、甜菜、油菜、葱、大蒜、西瓜、甜瓜、哈密瓜、木瓜、苹果、柑桔和桃树、茶、山野菜、竹笋、啤酒花、胡椒、香蕉、番木瓜、兰花、盆景。

[0044] 所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与所述抗病毒药剂中的任意一种或两种组合形成抗病毒组合物用于防治农业和林业以及园艺植物病毒病害；

[0045] 所述抗病毒药剂选自：苯并噻二唑、噻酰菌胺、异噻菌胺DL-β-氨基丁酸、2,6-二氯异烟酸、N-氰甲基-2-氯异烟酰胺、烯丙异噻唑、病毒唑、安托芬、宁南霉素、甲噻诱胺或水杨酸、嘧肽霉素、二氯异烟酸、烯丙异噻唑、井冈霉素、盐酸吗啉胍；

[0046] 所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III在所述抗病毒组合物中总的质量百分含量是1%-90%；优选地，所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与所述抗植物病毒剂的比例为质量百分比1%:99%到99%:1%；

[0047] 所述抗病毒组合物加工的剂型选自：种子处理乳剂、水乳剂、微乳剂、悬乳剂、胶囊悬浮剂、水溶性粒剂、细粒剂、可溶性浓剂、毒谷、块状毒饵、粒状毒饵、片状毒饵、浓毒饵、缓释块、静电喷雾剂、水包油乳剂、烟雾罐、烟雾烛、烟雾筒、烟雾棒、烟雾片、烟雾丸、发气剂、油膏、热雾剂、冷雾剂、气雾剂、固/液混合装剂、液/液混合装剂、固/固混合装剂、药漆、微粒剂、追踪粉剂、油悬剂、油分散性粉剂、浓胶剂、泼浇剂、种衣剂、涂抹剂、成膜油剂、超低容量液剂、蒸汽释放剂；

[0048] 所述抗病毒组合物防治的病毒病害选自：水稻矮缩病、黄矮病、条纹叶枯病、番茄蕨叶病毒病、辣椒花叶病毒病、烟草脉坏死病毒病、玉米矮花叶病、花椰菜花叶病毒、柑橘病毒病、建兰花叶病毒、建兰环斑病毒；

[0049] 所述抗病毒组合物用于防治的植物选自：稻谷、小麦、大麦、燕麦、玉米、高粱、甘薯、马铃薯、木薯、大豆、荷兰豆、蚕豆、豌豆、绿豆、小豆、棉花、蚕桑、花生、油菜、芝麻、向日葵、甜菜、甘蔗、咖啡、可可、人参、贝母、橡胶、椰子、油棕、剑麻、烟草、番茄、辣椒、萝卜、黄瓜、白菜、芹菜、榨菜、甜菜、油菜、葱、大蒜、西瓜、甜瓜、哈密瓜、木瓜、苹果、柑桔和桃树、茶、山野菜、竹笋、啤酒花、胡椒、香蕉、番木瓜、兰花、盆景。

[0050] 所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与所述杀螨剂中的任意一种或两种组合形成杀螨组合物用于防治农业和林业以及园艺植物螨害；

[0051] 所述杀螨剂选自：敌敌畏、庚烯磷、速灭磷、二溴磷、嘧啶磷、氯甲亚胺硫磷、乙硫磷、虫螨畏、伏杀硫磷、甲基嘧啶硫磷、喹硫磷、蚱灭多、胺丙畏、氯亚胺硫磷、亚胺硫磷、氟丙菊酯、联苯菊酯、氯氟氰菊酯、精高效氯氟氰菊酯、甲氰菊酯、氟氟氯苯菊酯、氟胺氰菊酯、溴氟菊酯、联苯肼酯、苯硫威、丁酮威、杀线威、抗虫威、久效威、苯菌灵、氯灭杀威、丁硫速灭威、蜚虱威、苯甲酸苄酯、溴螨酯、丁氟螨酯、灭螨醌、氟蚱螨、氟虫脲、浏阳霉素、虫螨霉素、苏云金素、杀螨素、浏阳霉素、阿维菌素、多拉菌素、埃普利诺菌素、伊维菌素、赛拉菌素、莫

西菌素、除虫菊素、烟碱、苦参碱、印楝素、鱼藤酮、吡螨胺、哒螨酮、唑螨酯、四螨嗪、炔螨特、噻螨酮、螺螨酯、啞螨酯、杀螨酯、克螨特、哒螨灵；

[0052] 所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III在所述杀螨组合中总的质量百分含量是1%-90%；所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与所述杀螨剂的比例为质量百分比1%:99%到99%:1%；

[0053] 所述杀螨组合加工的剂型选自：种子处理乳剂、水乳剂、微乳剂、悬乳剂、胶囊悬浮剂、水溶性粒剂、细粒剂、可溶性浓剂、毒谷、块状毒饵、粒状毒饵、片状毒饵、浓毒饵、缓释块、静电喷雾剂、水包油乳剂、烟雾罐、烟雾烛、烟雾筒、烟雾棒、烟雾片、烟雾丸、发气剂、油膏、热雾剂、冷雾剂、气雾剂、固/液混合装剂、液/液混合装剂、固/固混合装剂、药漆、微粒剂、追踪粉剂、油悬剂、油分散性粉剂、浓胶剂、泼浇剂、种衣剂、涂抹剂、成膜油剂、超低容量液剂、蒸汽释放剂；

[0054] 所述杀螨组合防治的螨害选自：螨害选自叶螨科、细须螨科、叶线螨、瘿螨科、红蜘蛛属、瘿螨科的害螨，所述害螨是世界性农业害螨、林业害螨、园艺害螨和卫生害螨；

[0055] 所述杀螨组合用于防治的植物选自：稻谷、小麦、大麦、燕麦、玉米、高粱、甘薯、马铃薯、木薯、大豆、荷兰豆、蚕豆、豌豆、绿豆、小豆、棉花、蚕桑、花生、油菜、芝麻、向日葵、甜菜、甘蔗、咖啡、可可、人参、贝母、橡胶、椰子、油棕、剑麻、烟草、番茄、辣椒、萝卜、黄瓜、白菜、芹菜、榨菜、甜菜、油菜、葱、大蒜、西瓜、甜瓜、哈密瓜、木瓜、苹果、柑桔和桃树、茶、山野菜、竹笋、啤酒花、胡椒、香蕉、番木瓜、兰花、盆景。

[0056] 所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与所述植物免疫激活剂中的任意一种或两种组合形成植物免疫激活剂组合用于防治农业和林业以及园艺植物病害；

[0057] 所述植物激活剂药剂选自：苯并噻二唑、异噻菌胺、S-诱抗素、寡糖链蛋白、氨基寡糖素、香菇多糖、氟唑活化酯、低聚糖素、几丁聚糖、毒氟磷、DL-β-氨基丁酸、2,6-二氯异烟酸、N-氰甲基-2-氯异烟酰胺、烯丙异噻唑、甲噻诱胺、冠菌素、水杨酸、井冈霉素、超敏蛋白、昆布素、吡唑醚菌酯、烯丙异噻唑噻菌灵；

[0058] 所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III在所述植物免疫激活剂组合中总的质量百分含量是1%-90%；优选地，所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与所述植物免疫激活剂的比例为质量百分比1%:99%到99%:1%；

[0059] 所述植物免疫激活剂组合加工的剂型选自：种子处理乳剂、水乳剂、微乳剂、悬乳剂、胶囊悬浮剂、水溶性粒剂、细粒剂、可溶性浓剂、毒谷、块状毒饵、粒状毒饵、片状毒饵、浓毒饵、缓释块、静电喷雾剂、水包油乳剂、烟雾罐、烟雾烛、烟雾筒、烟雾棒、烟雾片、烟雾丸、发气剂、油膏、热雾剂、冷雾剂、气雾剂、固/液混合装剂、液/液混合装剂、固/固混合装剂、药漆、微粒剂、追踪粉剂、油悬剂、油分散性粉剂、浓胶剂、泼浇剂、种衣剂、涂抹剂、成膜油剂、超低容量液剂、蒸汽释放剂；

[0060] 所述抗植物免疫激活剂组合防治的病害选自：稻苗绵腐病、番茄根腐病、马铃薯晚疫病、烟草黑胫病、谷子白粉病、葡萄霜霉病、莴苣霜霉病、黄瓜霜霉病、黄瓜炭疽病、水稻矮缩病、黄矮病、条纹叶枯病、番茄蕨叶病毒病、辣椒花叶病毒病、烟草脉坏死病毒病、玉米矮花叶病、花椰菜花叶病毒、柑橘病毒病、建兰花叶病毒、建兰环斑病毒；

[0061] 所述植物免疫激活剂组合用于防治的植物选自：稻谷、小麦、大麦、燕麦、玉米、高粱、甘薯、马铃薯、木薯、大豆、荷兰豆、蚕豆、豌豆、绿豆、小豆、棉花、蚕桑、花生、油菜、芝

麻、向日葵、甜菜、甘蔗、咖啡、可可、人参、贝母、橡胶、椰子、油棕、剑麻、烟草、番茄、辣椒、萝卜、黄瓜、白菜、芹菜、榨菜、甜菜、油菜、葱、大蒜、西瓜、甜瓜、哈密瓜、木瓜、苹果、柑桔和桃树、茶、山野菜、竹笋、啤酒花、胡椒、香蕉、番木瓜、兰花、盆景。

[0062] 本发明所述含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III的生物活性测定如下:

[0063] 本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III的杀菌活性测定:

[0064] 本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III的杀菌或抑菌活性采用菌丝生长速率法,菌丝生长速率法是利用病原菌菌丝在含有不同浓度药剂的培养基上生长速率的快慢来确定药剂抑菌能力大小的杀菌毒力测定方法,其具体步骤为:(1)制备带药平板。取10mg待测化合物,用400 μ L N,N-二甲基甲酰胺溶解,并用含吐温80乳化剂质量分数为0.1%的无菌水溶液定容至20mL,得到浓度为500 μ g/mL的待测药剂溶液。在超净工作台中配制带药培养基,吸取4mL待测药剂溶液置于灭菌的50离心管中,加入36mL马铃薯葡萄糖琼脂(Potato dextrose agar,PDA)培养基混匀,倒入灭菌的培养皿内,冷却后即含待测药剂50 μ g/mL的培养基平板。以添加相应体积N,N-二甲基甲酰胺和含0.1%吐温80的无菌水的PDA培养基做对照。(2)准备菌饼。将长期保存的菌种接种到无药PDA培养基上活化1-2次,待长势良好后,使用直径为4mm的打孔器于菌落外周1/3处切取菌饼。(3)接种菌饼。使用接种针移取菌饼至带药平板中央,使气生菌丝面朝下,封口膜密封后置于温度为24 $\pm$ 1 $^{\circ}$ C的恒温培养箱中倒置培养,每份处理均为3次重复。(4)数据调查。当空白对照的菌落接近培养皿边缘时,采用“十字交叉法”两次测量菌落直径,用其平均值代表菌落大小。(5)数据分析。将数据代入生长率计算公式,计算不同化合物的菌丝生长抑制率。供试菌种为我国农业生产中田间实际发生的大部分典型植物病原菌的种属,其代号和名称如下:A.s:番茄早疫病菌,其拉丁名为:Alternaria solani、B.c:黄瓜灰霉病菌,其拉丁名为:Botrytis cinerea、C.a:花生褐斑病菌,其拉丁名为:Cercospora arachidicola、F.g:禾谷镰孢病菌,其拉丁名为:Fusarium graminearum、P.p:苹果轮纹病菌,其拉丁名为:Physalospora piricola、R.s:水稻纹枯病菌,其拉丁名为:Rhizoctonia solani、S.s:油菜菌核病菌,其拉丁名为:Sclerotinia sclerotiorum。

[0065] 菌丝生长抑制率计算公式如下:

[0066] 生长抑制率(%) =
$$\frac{(\text{对照组菌落直径} - \text{菌饼直径}) - (\text{处理组菌落直径} - \text{菌饼直径})}{\text{对照组菌落直径} - \text{菌饼直径}} \times 100$$

[0067] 本发明的有益效果是:对含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III进行了合成,并对含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III进行了抑菌活性的筛选。

[0068] 本发明通过特定制备和生物活性测定实施例更加具体说明含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III的合成与生物活性及应用,所述实施例仅用于具体说明本发明而非限制本发明,尤其是生物活性仅是举例说明,而非限制本专利,具体实施方式如下:

[0069] 实施例1:化合物III-2a的制备:

[0070] 在200mL圆底烧瓶中加入硫代草酰胺乙酯(12mmol),溶于40mL无水乙醇,于室温搅拌状态下滴加化合物III-1a 2-溴环丙乙酮(10mmol),滴加完毕,反应体系转移至油浴加热至80 $^{\circ}$ C,回流反应2-4h,TLC进行监测,反应完全后将反应溶剂旋除,加适量乙酸乙酯溶解,用饱和氯化钠溶液洗涤2次,有机层用无水硫酸钠干燥。减压抽滤后残余物使用沸程60~90 $^{\circ}$ C的石油醚/乙酸乙酯(3:1,v/v)为洗脱剂,经100~200目硅胶柱层析纯化得到中间体III-

2a,产率87%。

[0071] 实施例2:化合物III-3a的制备:

[0072] 在200mL圆底烧瓶中加入上述制备的化合物III-2a (10mmol),溶于40mL无水乙醇,于室温搅拌状态下滴加80%水合肼 (12mmol),滴加完毕,反应体系转移至油浴加热至80℃,回流反应2-4h,TLC进行监测,反应完全以后冷却至室温继续搅拌反应1-2h,得到大量固体,减压抽滤得到固体中间体III-3a,产率90%。

[0073] 实施例3:化合物GW-III-5j的制备:

[0074] 在50mL圆底烧瓶中加入上述制备的化合物III-3a (1mmol)和三氯乙酸III-4a (1.1mmol),滴加8mL三氯氧磷,将反应体系转移至油浴加热至100℃,反应3h。反应结束,将反应体系冷却至室温后逐滴加入到200mL冰水中淬灭反应,搅拌状态下逐滴加入饱和碳酸氢钠溶液调节pH至7-8 (有大量气泡生成),之后水相用乙酸乙酯萃取2次 (50mL×2),合并有机层用饱和氯化钠溶液洗涤2次,合并有机层用无水硫酸钠干燥。减压抽滤后残余物使用沸程60~90℃的石油醚/乙酸乙酯 (3:1,v/v) 为洗脱剂,经100~200目硅胶柱层析纯化得到目标化合物GW-III-5j,白色固体,产率72%。

[0075] 实施例4:本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III的抑菌活性测定结果:

[0076] 本发明测试的常见植物病原真菌代号和名称如下:A.s:番茄早疫病菌,其拉丁名为:*Alternaria solani*、B.c:黄瓜灰霉病菌,其拉丁名为:*Botrytis cinerea*、C.a:花生褐斑病菌,其拉丁名为:*Cercospora arachidicola*、F.g:禾谷镰孢病菌,其拉丁名为:*Fusarium graminearum*、P.p:苹果轮纹病菌,其拉丁名为:*Physalospora piricola*、R.c:禾谷丝核病菌,其拉丁名为:*Rhizoctonia cerealis*、R.s:水稻纹枯病菌,其拉丁名为:*Rhizoctonia solani*、S.s:油菜菌核病菌,其拉丁名为:*Sclerotinia sclerotiorum*。这些菌种具有很好的代表性,能够代表农业生产中田间发生的大部分病原菌的种属。以先导化合物YZK-C22及商品化药剂噻呋酰胺、粉唑醇和吡唑醚菌酯作为阳性对照。表2中50微克/毫升浓度时的离体杀菌活性结果表明,本发明中目标化合物GW-III-5a~GW-III-5u对所测试的七种病原真菌均具有一定程度的离体杀菌活性。

[0077] 化合物GW-III-5b、GW-III-5g、GW-III-5h、GW-III-5j和GW-III-5q对A.solani的抑制率在64.0%~75.0%之间,表现出优于噻呋酰胺 (67.2%) 或与之相当的抑菌活性。化合物GW-III-5b、GW-III-5g、GW-III-5h、GW-III-5j、GW-III-5l、GW-III-5p、GW-III-5q和GW-III-5s对B.cinerea的抑制率在64.4%~94.1%之间,均优于噻呋酰胺 (32.4%);其中,化合物GW-III-5j、GW-III-5l和GW-III-5s的抑制率分别为94.1%、93.0%和92.2%,优于先导化合物YZK-C22 (82.6%),与吡唑醚菌酯 (96.6%)、粉唑醇 (96.1%) 相当。化合物GW-III-5b、GW-III-5g、GW-III-5h、GW-III-5j、GW-III-5l和GW-III-5q对C.arachidicola的抑制率在60.5%~92.7%之间,其中,GW-III-5b、GW-III-5h和GW-III-5j的抑制率分别为84.2%、85.3%和92.7%,表现出优于先导化合物YZK-C22 (82.6%) 或与之相当的抑菌活性。GW-III-5j与吡唑醚菌酯 (95.9%)、粉唑醇 (97.1%) 相当。化合物GW-III-5j和GW-III-5l对F.graminearum的抑制率分别为79.0%和73.9%,均优于噻呋酰胺 (43.6%)。其中,化合物GW-III-5j的抑菌活性与先导化合物YZK-C22 (82.1%) 和吡唑醚菌酯 (83.8%) 相当。GW-III系列化合物对R.solani表现出优异的抑制活性。化合物GW-III-5b、GW-III-5c、GW-III-5g、GW-III-5h、GW-III-5i、GW-III-5j、GW-III-5l、GW-III-5p、GW-III-5q和GW-III-5s

对*R.solani*的抑制作用大于70%,其中,化合物GW-III-5g、GW-III-5j、GW-III-5l、GW-III-5p、GW-III-5q和GW-III-5s抑制率分别为89.8%、100%、100%、90.3%、95.6%和89.6%,表现出优于先导化合物YZK-C22(93.8%)、吡唑醚菌酯(96.9%)、粉唑醇(95.3%)和噻呋酰胺(90.2%)或与之相当的抑制活性。化合物GW-III-5j对*S.sclerotiorum*的抑制率分别为65.7%,优于噻呋酰胺(15.2%),与吡唑醚菌酯(60.2%)相当。

[0078] 综上所述,化合物GW-III-5b、GW-III-5g、GW-III-5h、GW-III-5j、GW-III-5l、GW-III-5p、GW-III-5q和GW-III-5s表现出较高的杀菌活性。

[0079] 实施例5:本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与杀虫剂组合在防治农业和林业以及园艺植物虫害中的应用:

[0080] 本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与商品杀虫剂中的任意一种或两种组合形成杀虫组合物用于防治农业和林业以及园艺植物虫害,所述商品杀虫剂选自:烯虫酯、地虫啉、啉虫脒、甲氨基阿维菌素、吡啶菌素、阿维菌素、多杀菌素、七氟甲醚菊酯、氯氟醚菊酯、高效氯氰菊酯、高效氯氟菊酯、三氟氯氰菊酯、溴氰菊酯、甲氰菊酯、 β -氟氯氰菊酯、 λ -三氟氯氰菊酯、二氯苯醚菊酯、苄氯菊酯、丙烯菊酯、联苯菊酯、氯菊酯、醚菊酯、氟氯苯菊酯、氟胺氰菊酯、吡虫啉、烯啶虫胺、氯噻啉、噻虫啉、噻虫嗪、噻虫胺、呋虫胺、可尼丁、达特南、除虫脲、灭幼脲、伏虫隆、除虫隆、氟铃脲、氟虫脲、啉虫隆、虱螨脲、毒虫脲、氟幼脲、多氟脲、氟螨脲、双苯氟脲、氟啉脲、噻虫脲、双三氟虫脲、呋喃虫酰肼、虫酰肼、氯虫酰肼、甲氧虫酰肼、环虫酰肼、敌敌畏、啉硫磷、啉啉硫磷、叶蝉散、西维因、抗蚜威、速灭威、异丙威、杀螟丹、仲丁威、叶飞散、甲萘威、杀螟丹、溴螨酯、噻螨酮、啉螨酯、啉啉酮、四螨嗪、炔螨特、丁醚脲、吡蚜酮、螺螨酯、螺虫酯、螺虫乙酯、三唑锡、噻嗪酮、杀虫单、杀虫双、氯虫酰胺、四氯虫酰胺、氟虫酰胺、氟啉虫酰胺、氰虫酰胺、丁烯氟虫腈、啉虫酰胺、溴虫腈、吡啶酮、乙螨唑、吡啶胺、啉幼酮、吡丙醚、埃玛菌素、戊吡虫脲;本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III在所述杀虫组合物中的质量百分含量是1%-90%,本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与前述商品杀虫剂的比例为质量百分比1%:99%到99%:1%;所述杀虫组合物加工的剂型选自:种子处理乳剂、水乳剂、微乳剂、悬乳剂、胶囊悬浮剂、水溶性粒剂、细粒剂、可溶性浓剂、毒谷、块状毒饵、粒状毒饵、片状毒饵、浓毒饵、缓释块、静电喷雾剂、水包油乳剂、烟雾罐、烟雾烛、烟雾筒、烟雾棒、烟雾片、烟雾丸、发气剂、油膏、热雾剂、冷雾剂、气雾剂、固/液混合装剂、液/液混合装剂、固/固混合装剂、药漆、微粒剂、追踪粉剂、油悬剂、油分散性粉剂、浓胶剂、泼浇剂、种衣剂、涂抹剂、成膜油剂、超低容量液剂、蒸汽释放剂;所述杀虫组合物适用的植物虫害选自:草地贪夜蛾、红蜘蛛、东亚飞蝗、云斑车蝗、中华稻蝗、日本黄脊蝗、单刺蝼蛄、东方蝼蛄、稻蓟马、烟蓟马、温室蓟马、稻管蓟马、麦管蓟马、温室白粉虱、烟粉虱、黑尾叶蝉、大青叶蝉、棉叶蝉、斑衣蜡蝉、褐飞虱、白背飞虱、灰飞虱、甘蔗扁角飞虱、棉蚜、麦二叉蚜、麦长管蚜、桃蚜、高粱蚜、萝卜蚜、吹绵蚧、桑盾蚧、矢尖盾蚧、梨圆蚧、白蜡虫、红蜡蚧、朝鲜球坚蚧、梨网蝽、香蕉网蝽、细角花蝽、微小花蝽、针缘蝽、稻蛛缘蝽、稻褐蝽、稻黑蝽、稻绿蝽、绿盲蝽、苜蓿盲蝽、中黑盲蝽、大草蛉、丽草蛉、中华草蛉、谷蛾、衣蛾、黄刺蛾、褐刺蛾、扁刺蛾、麦蛾、棉红铃虫、甘薯麦蛾、小菜蛾、桃小食心虫、大豆食心虫、桃小食心虫、苹果顶梢卷叶蛾、褐带长卷叶蛾、拟小黄卷叶蛾、二化螟、豆荚螟、玉米螟、三化螟、菜螟、稻纵卷叶螟、条螟、棉卷叶野螟、桃蛀螟、黏虫、斜纹夜蛾、稻螟蛉、棉小造桥虫、甜菜夜蛾、大螟、棉铃虫、鼎点金刚钻、小地老虎、大地老虎、黄地老虎、盗毒蛾、舞毒蛾、甘薯天蛾、

豆天蛾、直纹稻弄蝶、隐纹谷弄蝶、柑橘凤蝶、玉带凤蝶、菜粉蝶、苎麻赤蛱蝶、苎麻黄蛱蝶、豆芫菁、金星步甲、皱鞘步甲、麦穗步甲、沟金针虫、细胸金针虫、谷斑皮蠹、黑皮蠹、柑橘小吉丁虫、金缘吉丁虫、黄粉虫、黑粉虫、赤拟谷盗、杂拟谷盗、铜绿异丽金龟、暗黑金龟、华北大黑鳃金龟、桑天牛、星天牛、橘褐天牛、桃红颈天牛、大猿叶虫、小猿叶虫、黄守瓜、黄曲条跳甲、绿豆象、豌豆象、蚕豆象、玉米象、米象、小麦叶蜂、梨实蜂、黄带姬蜂、黏虫白星姬蜂、螟蛉悬茧姬蜂、棉铃虫齿唇姬蜂、螟黑点疣姬蜂、蚊、蝇、虻、麦红吸浆虫、麦黄吸浆虫、稻瘿蚊、柑橘大实蝇、瓜实蝇、麦叶灰潜蝇、美洲斑潜蝇、豆秆黑潜蝇、麦秆蝇、种蝇、葱蝇、萝卜蝇、伞裙追寄蝇、玉米螟厉寄蝇、黏虫；所述杀虫组合物适用的植物选自：稻谷、小麦、大麦、燕麦、玉米、高粱、甘薯、马铃薯、木薯、大豆、荷兰豆、蚕豆、豌豆、绿豆、小豆、棉花、蚕桑、花生、油菜、芝麻、向日葵、甜菜、甘蔗、咖啡、可可、人参、贝母、橡胶、椰子、油棕、剑麻、烟草、番茄、辣椒、萝卜、黄瓜、白菜、芹菜、榨菜、甜菜、油菜、葱、大蒜、西瓜、甜瓜、哈密瓜、木瓜、苹果、柑桔和桃树、茶、山野菜、竹笋、啤酒花、胡椒、香蕉、番木瓜、兰花、盆景。

[0081] 实施例6：本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与杀菌剂组合在防治农业和林业以及园艺植物病害中的应用：

[0082] 本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与商品杀菌剂中的任意一种或两种组合形成杀菌组合物用于防治农业和林业以及园艺植物病害，所述商品杀菌剂选自：苯并噻二唑、噻酰菌胺、甲噻诱胺、异噻菌胺、病毒唑、安托芬、宁南霉素或水杨酸、霜脲氰、福美双、福美锌、代森锰锌、乙磷铝、甲基硫菌灵、百菌清、敌可松、腐霉利、苯锈啉、甲基托布津、托布津、精甲霜灵、氟吗啉、烯酰吗啉、高效甲霜灵、高效苯霜灵、双氯氰菌胺、磺菌胺、甲磺菌胺、噻氟菌胺、叶枯酞、环丙酰菌胺、环氟菌胺、环酰菌胺、氰菌胺、硅噻菌胺、萎锈灵、氧化萎锈灵、麦锈灵、甲呋酰胺、灭锈胺、氟酰胺、呋吡菌胺、噻呋酰胺、啉酰菌胺、吡噻菌胺、吡唑萘菌胺、联苯吡菌胺、氟吡菌酰胺、氟唑环菌胺、氟唑菌酰胺、氟唑菌苯胺、苯丙烯氟菌唑、异丙噻菌胺、氟唑菌酰羟胺、氟苯醚酰胺、氟醚菌酰胺、双炔酰菌胺、苯酰菌胺、乙菌利、异菌脲、嘧菌酯、醚菌胺、氟嘧菌酯、醚菌酯、苯氧菌胺、肟醚菌胺、啉氧菌酯、唑菌胺酯、肟菌酯、烯肟菌酯、烯肟菌胺、氧环唑、糠菌唑、环丙唑醇、苯醚甲环唑、烯唑醇、高效烯唑醇、氟环唑、腈苯唑、氟唑唑、氟硅唑、粉唑醇、己唑醇、亚胺唑、种菌唑、叶菌唑、腈菌唑、戊菌唑、丙环唑、丙硫菌唑、硅氟唑、戊唑醇、四氟醚唑、三唑醇、灭菌唑、联苯三唑醇、噻菌灵、麦穗宁、抑霉唑、高效抑霉唑、咪鲜胺、氟菌唑、氰霜唑、咪唑菌酮、噁咪唑、稻瘟酯、噁唑菌酮、啉菌噁唑、噁霉灵、噁霜灵、噻唑菌胺、土菌灵、辛噻酮、苯噻硫氰、十二环吗啉、丁苯吗啉、十三吗啉、拌种咯、咯菌腈、氟啉胺、啉斑肟、环啉菌胺、氟啉酰菌胺、啉菌胺、嘧菌环胺、氟嘧菌胺、噻呋酰胺、嘧菌胺、嘧霉胺、氯苯嘧啶醇、氟苯嘧啶醇、灭螨猛、二氰蒽醌、乙氧喹啉、羟基喹啉、丙氧喹啉、苯氧喹啉、乙霉威、异丙菌胺、苯噻菌胺、霜霉威、磺菌威、敌瘟磷、异稻瘟净、吡菌磷、甲基立枯磷、灭瘟素、春雷霉素、多抗霉素、多氧霉素、有效霉素、井冈霉素、链霉素、甲霜灵、呋霜灵、苯霜灵、呋酰胺、多菌灵、苯菌灵、甲基硫菌灵、三唑酮、乙嘧酚磺酸酯、二甲嘧酚、乙嘧酚、敌菌丹、克菌丹、灭菌丹、乙烯菌核利、氟氯菌核利、菌核净、百菌清、稻瘟灵、稻瘟净、叶枯唑、五氯硝基苯、丙森锌、三乙膦酸铝、硫磺、波尔多液、硫酸铜、氧氯化铜、氧化亚铜、氢氧化铜、苯菌酮、戊菌隆、啉菌酮、四氯苯酞、咯嗪酮、螺环菌胺、三环唑、噻胺灵、多果啉、双胍辛盐、双胍辛胺、氯硝胺、苯磺菌胺、甲苯磺菌胺、吡啉酯、敌磺钠、唑菌酮、烯丙苯噻唑、溴硝醇、碘甲烷、威百亩、敌线酯、棉隆、二氯异丙醚、噻唑磷、丰索磷、虫线磷、除线磷、丁硫环

磷、杀线威、硫酰氟、二氯丙烯、二氯异烟酸、烯丙异噻唑；本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III在所述杀菌组合物中总的质量百分含量是1%-90%，本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与前述商品杀菌剂的量百分比为1%:99%到99%:1%；所述杀菌组合物加工的剂型选自：种子处理乳剂、水乳剂、微乳剂、悬乳剂、胶囊悬浮剂、水溶性粒剂、细粒剂、可溶性浓剂、毒谷、块状毒饵、粒状毒饵、片状毒饵、浓毒饵、缓释块、静电喷雾剂、水包油乳剂、烟雾罐、烟雾烛、烟雾筒、烟雾棒、烟雾片、烟雾丸、发气剂、油膏、热雾剂、冷雾剂、气雾剂、固/液混合装剂、液/液混合装剂、固/固混合装剂、药漆、微粒剂、追踪粉剂、油悬剂、油分散性粉剂、浓胶剂、泼浇剂、种衣剂、涂抹剂、成膜油剂、超低容量液剂、蒸汽释放剂；所述杀菌组合物适用的植物病害选自：稻苗绵腐病、番茄根腐病、马铃薯晚疫病、烟草黑胫病、谷子白粉病、葡萄霜霉病、莴苣霜霉病、黄瓜霜霉病、黄瓜炭疽病；所述杀菌组合物适用的植物选自：稻谷、小麦、大麦、燕麦、玉米、高粱、甘薯、马铃薯、木薯、大豆、荷兰豆、蚕豆、豌豆、绿豆、小豆、棉花、蚕桑、花生、油菜、芝麻、向日葵、甜菜、甘蔗、咖啡、可可、人参、贝母、橡胶、椰子、油棕、剑麻、烟草、番茄、辣椒、萝卜、黄瓜、白菜、芹菜、榨菜、甜菜、油菜、葱、大蒜、西瓜、甜瓜、哈密瓜、木瓜、苹果、柑桔和桃树、茶、山野菜、竹笋、啤酒花、胡椒、香蕉、番木瓜、兰花、盆景。

[0083] 实施例7：本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与抗植物病毒剂组合在防治农业和林业以及园艺植物病毒病害中的应用：

[0084] 本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与商品抗病毒药剂中的任意一种或两种组合形成抗病毒组合物用于防治农业和林业以及园艺植物病毒病害，所述商品抗病毒药剂选自：苯并噻二唑、噻酰菌胺、异噻菌胺、病毒唑、安托芬、宁南霉素、甲噻诱胺或水杨酸、嘧肽霉素、二氯异烟酸、烯丙异噻唑、井冈霉素、盐酸吗啉胍；本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III在所述抗病毒组合物中总的质量百分含量是1%-90%，本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与前述商品抗植物病毒剂的比例为质量百分比1%:99%到99%:1%；所述抗病毒组合物加工的剂型选自：种子处理乳剂、水乳剂、微乳剂、悬乳剂、胶囊悬浮剂、水溶性粒剂、细粒剂、可溶性浓剂、毒谷、块状毒饵、粒状毒饵、片状毒饵、浓毒饵、缓释块、静电喷雾剂、水包油乳剂、烟雾罐、烟雾烛、烟雾筒、烟雾棒、烟雾片、烟雾丸、发气剂、油膏、热雾剂、冷雾剂、气雾剂、固/液混合装剂、液/液混合装剂、固/固混合装剂、药漆、微粒剂、追踪粉剂、油悬剂、油分散性粉剂、浓胶剂、泼浇剂、种衣剂、涂抹剂、成膜油剂、超低容量液剂、蒸汽释放剂；所述抗病毒组合物防治的病毒病害选自：水稻矮缩病、黄矮病、条纹叶枯病、番茄蕨叶病毒病、辣椒花叶病毒病、烟草脉坏死病毒病、玉米矮花叶病、花椰菜花叶病毒、柑橘病毒病、建兰花叶病毒、建兰环斑病毒；所述抗病毒组合物用于防治的植物选自：稻谷、小麦、大麦、燕麦、玉米、高粱、甘薯、马铃薯、木薯、大豆、荷兰豆、蚕豆、豌豆、绿豆、小豆、棉花、蚕桑、花生、油菜、芝麻、向日葵、甜菜、甘蔗、咖啡、可可、人参、贝母、橡胶、椰子、油棕、剑麻、烟草、番茄、辣椒、萝卜、黄瓜、白菜、芹菜、榨菜、甜菜、油菜、葱、大蒜、西瓜、甜瓜、哈密瓜、木瓜、苹果、柑桔和桃树、茶、山野菜、竹笋、啤酒花、胡椒、香蕉、番木瓜、兰花、盆景。

[0085] 实施例8：本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与杀螨剂组合在防治农业和林业以及园艺植物螨害中的应用：

[0086] 本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与商品杀螨剂中的任意一种或两

种组合形成杀螨组合物用于防治农业和林业以及园艺植物螨害,所述商品杀螨剂选自:敌敌畏、庚烯磷、速灭磷、二溴磷、嘧啶磷、氯甲亚胺硫磷、乙硫磷、虫螨畏、伏杀硫磷、甲基嘧啶硫磷、喹硫磷、蚜灭多、胺丙畏、氯亚胺硫磷、亚胺硫磷、氟丙菊酯、联苯菊酯、氯氟氰菊酯、精高效氯氟氰菊酯、甲氰菊酯、氟氟氯苯菊酯、氟胺氰菊酯、溴氟菊酯、联苯肼酯、苯硫威、丁酮威、杀线威、抗虫威、久效威、苯菌灵、氯灭杀威、丁硫速灭威、蜚虱威、苯甲酸苄酯、溴螨酯、丁氟螨酯、灭螨醌、氟蚜螨、氟虫脲、浏阳霉素、虫螨霉素、苏云金素、杀螨素、浏阳霉素、阿维菌素、多拉菌素、埃普利诺菌素、伊维菌素、赛拉菌素、莫西菌素、除虫菊素、烟碱、苦参碱、印楝素、鱼藤酮、吡螨胺、哒螨酮、唑螨酯、四螨嗪、炔螨特、噻螨酮、螺螨酯、嘧螨酯、杀螨酯、克螨特、哒螨灵;本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III在所述杀螨组合物中总的质量百分含量是1%-90%,本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与所述商品杀螨剂的比例为质量百分比1%:99%到99%:1%;所述杀螨组合物加工的剂型选自:种子处理乳剂、水乳剂、微乳剂、悬乳剂、胶囊悬浮剂、水溶性粒剂、细粒剂、可溶性浓剂、毒谷、块状毒饵、粒状毒饵、片状毒饵、浓毒饵、缓释块、静电喷雾剂、水包油乳剂、烟雾罐、烟雾烛、烟雾筒、烟雾棒、烟雾片、烟雾丸、发气剂、油膏、热雾剂、冷雾剂、气雾剂、固/液混合装剂、液/液混合装剂、固/固混合装剂、药漆、微粒剂、追踪粉剂、油悬剂、油分散性粉剂、浓胶剂、泼浇剂、种衣剂、涂抹剂、成膜油剂、超低容量液剂、蒸汽释放剂;所述杀螨组合物防治的螨害选自:螨害选自叶螨科、细须螨科、蛛线螨、瘿螨科、红叶螨属、瘿螨科的害螨,这些害螨是世界性农业害螨、林业害螨、园艺害螨和卫生害螨;所述杀螨组合物用于防治的植物选自:稻谷、小麦、大麦、燕麦、玉米、高粱、甘薯、马铃薯、木薯、大豆、荷兰豆、蚕豆、豌豆、绿豆、小豆、棉花、蚕桑、花生、油菜、芝麻、向日葵、甜菜、甘蔗、咖啡、可可、人参、贝母、橡胶、椰子、油棕、剑麻、烟草、番茄、辣椒、萝卜、黄瓜、白菜、芹菜、榨菜、甜菜、油菜、葱、大蒜、西瓜、甜瓜、哈密瓜、木瓜、苹果、柑桔和桃树、茶、山野菜、竹笋、啤酒花、胡椒、香蕉、番木瓜、兰花、盆景。

[0087] 实施例9:本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III在制备农药组合物中的应用:

[0088] 本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III制备农药组合物,该组合物含本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III为活性成分,活性成分的质量百分含量为0.1%到99.9%,固体或液体助剂的质量百分含量为99.9%到0.1%,此外还含有任选0到25%质量百分含量的表面活性剂。

[0089] 实施例10:本发明含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III在制备农药复配组合物中的应用:

[0090] 本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III可与其他商品农药,即杀虫剂、杀螨剂、杀菌剂、抗病毒剂或植物激活剂复配制备农药复配组合物,该复配组合物包含本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III和商品农药,即杀虫剂、杀螨剂、杀菌剂、抗病毒剂或植物激活剂作为活性成分,本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III与其他商品农药,即杀虫剂、杀螨剂、杀菌剂、抗病毒剂或植物激活剂的比例为质量百分比1%:99%到99%:1%,活性成分的质量百分含量为0.1%到99.9%,99.9%到0.1%质量百分含量的固体或液体助剂,以及任选0到25%质量百分含量的表面活性剂。

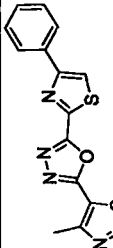
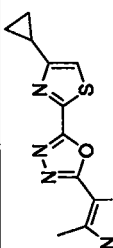
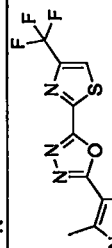
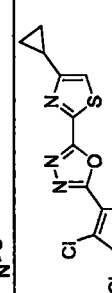
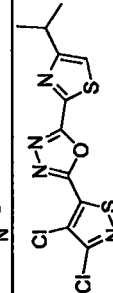
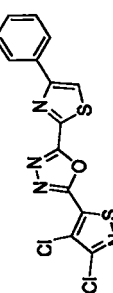
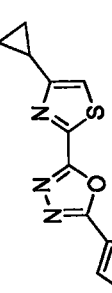
[0091] 工业实用性

[0092] 本发明提供一类含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物;本发明所述衍生物能够调控农

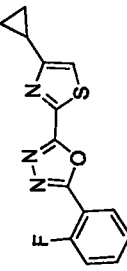
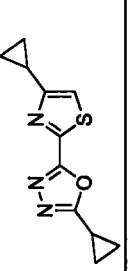
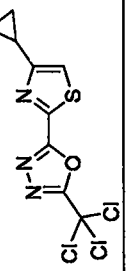
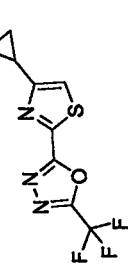
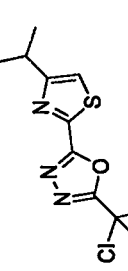
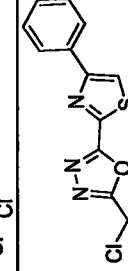
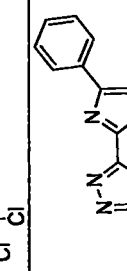
业、园艺和卫生以及林业植物害虫和植物病原物的生物活性,可用于农业领域、园艺领域、林业领域杀虫、杀螨、杀菌、抗植物病毒、诱导植物产生抗病性,具有较好的经济价值和应用前景。

[0093]

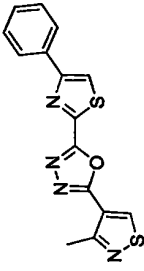
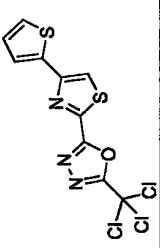
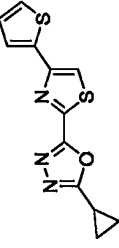
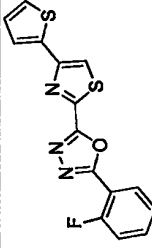
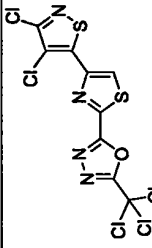
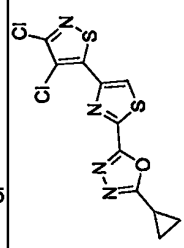
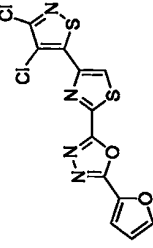
表 1 本发明的含 1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物 GW-III 的化学结构和理化参数

序号	编号	化学结构	¹ H NMR(CDCl ₃ /DMSO- <i>d</i> ₆ /Methanol- <i>d</i> ₄ , 400/600MHz, ppm)	收率%	外观
1	GW-III-5a		¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ 8.01 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.50 (dd, <i>J</i> = 15.9, 8.3 Hz, 1H), 7.43 (dd, <i>J</i> = 13.4, 6.2 Hz, 1H), 3.21 (s, 1H).	75	白色固体
2	GW-III-5b		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.21 (s, 1H), 3.18 (s, 3H), 2.28-2.14 (m, 1H), 1.11-1.00 (m, 4H).	71	白色固体
3	GW-III-5c		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.10 (s, 1H), 3.15 (s, 3H).	67	黄色固体
4	GW-III-5d		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.23 (s, 1H), 2.18-2.25 (m, 1H), 1.11-1.02 (m, 4H).	40	黄色固体
5	GW-III-5e		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.29 (s, 1H), 3.36-3.17 (m, 1H), 1.40 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 6H).	56	白色固体
6	GW-III-5f		¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ 8.01 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.56-7.46 (m, 1H), 7.45-7.36 (m, 1H).	43	白色固体
7	GW-III-5g		¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ 7.70 (s, 1H), 7.33 (d, <i>J</i> = 3.2 Hz, 1H), 7.13 (s, 1H), 6.64 (d, <i>J</i> = 1.3 Hz, 1H), 2.27-2.10 (m, 1H), 1.08-0.97 (m, 4H).	89	白色固体

[0094]

8	GW-III-5h		¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ 8.16 (t, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 7.62-7.53 (m, 1H), 7.33 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 7.28 (t, <i>J</i> = 9.4 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 2.27-2.13 (m, 1H), 1.03 (d, <i>J</i> = 8.2 Hz, 3H).	62	白色固体
9	GW-III-5i		¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ 7.05 (s, 1H), 2.29-2.20 (m, 1H), 2.20-2.11 (m, 1H), 1.28 (d, <i>J</i> = 2.9 Hz, 2H), 1.21 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 1.01 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 2H), 0.96 (d, <i>J</i> = 3.4 Hz, 2H).	41	黄色固体
10	GW-III-5j		¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ 7.20 (s, 1H), 2.25-2.14 (m, 1H), 1.10-0.99 (m, 1H).	72	白色固体
11	GW-III-5k		¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ 7.26 (s, 1H), 2.28-2.07 (m, 1H), 1.10-0.96 (m, 4H).	69	白色固体
12	GW-III-5l		¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ 7.29 (s, 1H), 3.28 (dt, <i>J</i> = 13.7, 6.8 Hz, 1H), 1.39 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 6H).	39	白色固体
13	GW-III-5m		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.01 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 7.83 (s, 1H), 7.53-7.46 (m, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H).	49	黄色固体
14	GW-III-5n		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.06-7.99 (m, 2H), 7.87 (s, 1H), 7.52 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 2H), 7.49-7.42 (m, 1H).	92	黄色固体

[0095]

15	GW-III-5o		¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ 9.43 (s, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.76 (s, 1H), 7.56-7.46 (m, 1H), 7.44-7.38 (m, 1H), 2.95 (s, 1H).	59	黄色固体
16	GW-III-5p		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.68 (s, 1H), 7.59 (s, 1H), 7.37 (d, <i>J</i> = 5.0 Hz, 1H), 7.11 (t, <i>J</i> = 3.8 Hz, 1H).	55	绿色固体
17	GW-III-5q		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.64 (s, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.39 (d, <i>J</i> = 35.3 Hz, 1H), 7.14 (d, <i>J</i> = 37.6 Hz, 1H), 2.32 (dd, <i>J</i> = 33.9, 4.9 Hz, 1H), 1.32 (t, <i>J</i> = 29.7 Hz, 4H).	47	黄色固体
18	GW-III-5r		¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ 8.24-8.17 (m, 1H), 7.66-7.54 (m, 1H), 7.41-7.33 (m, 1H), 7.33-7.28 (m, 1H), 7.15-7.06 (m, 1H).	60	黄色固体
19	GW-III-5s		¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ 8.51 (s, 1H).	80	白色固体
20	GW-III-5t		¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ 8.37 (s, 1H), 2.45-2.15 (m, 1H), 1.40-1.17 (m, 4H).	73	黄色固体
21	GW-III-5u		¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ 8.43 (s, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.40 (s, 1H), 6.68 (s, 1H).	57	白色固体

[0096] 表2本发明的含1,3,4-噁二唑联噻唑衍生物GW-III的抑菌活性(50微克/毫升的抑制率/%)

化合物编号	50 $\mu\text{g/mL}$ 浓度下的离体抑菌活性(%)						
	<i>A.s</i>	<i>B.c</i>	<i>C.a</i>	<i>F.g</i>	<i>P.p</i>	<i>R.s</i>	<i>S.s</i>
GW-III-5a	14.0 $\pm$ 1.0	4.4 $\pm$ 1.1	20.9 $\pm$ 1.0	15.6 $\pm$ 1.0	8.0 $\pm$ 0.8	16.9 $\pm$ 0.4	13.9 $\pm$ 1.7
GW-III-5b	67.5 $\pm$ 1.1	88.2 $\pm$ 1.1	84.2 $\pm$ 1.1	38.6 $\pm$ 1.0	47.1 $\pm$ 1.3	71.1 $\pm$ 1.1	43.6 $\pm$ 0.9
GW-III-5c	33.8 $\pm$ 1.1	49.8 $\pm$ 0.6	11.6 $\pm$ 1.1	17.9 $\pm$ 0.6	30.3 $\pm$ 0.7	84.3 $\pm$ 0.4	22.3 $\pm$ 0.9
GW-III-5d	19.4 $\pm$ 1.9	39.3 $\pm$ 0.6	25.0 $\pm$ 1.8	9.1 $\pm$ 0.6	23.5 $\pm$ 1.9	46.7 $\pm$ 0.7	21.8 $\pm$ 1.6
GW-III-5e	18.6 $\pm$ 2.7	13.3 $\pm$ 1.9	44.1 $\pm$ 1.7	23.1 $\pm$ 0.6	15.6 $\pm$ 1.3	53.7 $\pm$ 0.4	20.9 $\pm$ 1.5
GW-III-5f	12.2 $\pm$ 2.0	32.6 $\pm$ 1.7	25.4 $\pm$ 1.7	19.3 $\pm$ 0.6	11.6 $\pm$ 1.3	34.0 $\pm$ 1.2	14.4 $\pm$ 3.1
GW-III-5g	64.0 $\pm$ 1.0	70.4 $\pm$ 0.6	60.5 $\pm$ 2.6	42.4 $\pm$ 0.6	44.2 $\pm$ 1.6	89.8 $\pm$ 1.1	37.3 $\pm$ 1.5
GW-III-5h	64.5 $\pm$ 1.0	76.3 $\pm$ 0.6	85.3 $\pm$ 1.0	51.5 $\pm$ 0.6	50.9 $\pm$ 2.1	80.1 $\pm$ 0.4	50.3 $\pm$ 0.9
GW-III-5i	23.8 $\pm$ 2.0	40.4 $\pm$ 1.7	36.7 $\pm$ 1.0	23.4 $\pm$ 2.1	16.1 $\pm$ 1.6	77.1 $\pm$ 0.7	26.4 $\pm$ 0.9
GW-III-5j	70.9 $\pm$ 1.0	94.1 $\pm$ 0.6	92.7 $\pm$ 1.0	79.0 $\pm$ 0.6	58.9 $\pm$ 0.8	100	65.7 $\pm$ 1.5
GW-III-5k	23.8 $\pm$ 2.0	13.3 $\pm$ 1.9	25.0 $\pm$ 1.8	38.6 $\pm$ 1.0	24.6 $\pm$ 1.6	46.7 $\pm$ 0.7	16.4 $\pm$ 1.5
[0097] GW-III-5l	59.9 $\pm$ 2.7	93.0 $\pm$ 0.6	76.8 $\pm$ 2.0	73.9 $\pm$ 0.6	53.6 $\pm$ 2.1	100	54.7 $\pm$ 0.9
GW-III-5m	15.1 $\pm$ 2.0	33.3 $\pm$ 1.1	26.6 $\pm$ 2.0	14.9 $\pm$ 0.6	12.1 $\pm$ 0.8	20.1 $\pm$ 0.7	14.9 $\pm$ 1.5
GW-III-5n	14.5 $\pm$ 1.7	36.3 $\pm$ 0.6	28.3 $\pm$ 2.0	18.0 $\pm$ 0.6	16.1 $\pm$ 2.1	42.1 $\pm$ 0.4	10.0 $\pm$ 1.7
GW-III-5o	16.3 $\pm$ 1.7	27.4 $\pm$ 0.6	25.4 $\pm$ 1.7	15.6 $\pm$ 1.0	24.6 $\pm$ 1.6	40.3 $\pm$ 0.7	12.9 $\pm$ 2.3
GW-III-5p	20.9 $\pm$ 1.0	64.4 $\pm$ 1.9	36.2 $\pm$ 1.0	26.4 $\pm$ 1.2	21.0 $\pm$ 1.3	90.3 $\pm$ 0.7	16.4 $\pm$ 1.5
GW-III-5q	75.0 $\pm$ 1.0	74.1 $\pm$ 0.6	77.4 $\pm$ 1.0	50.5 $\pm$ 1.6	55.4 $\pm$ 1.6	95.6 $\pm$ 0.4	57.2 $\pm$ 0.9
GW-III-5r	15.1 $\pm$ 1.0	10.4 $\pm$ 0.6	28.8 $\pm$ 1.7	14.9 $\pm$ 1.6	16.5 $\pm$ 2.8	18.8 $\pm$ 0.7	13.9 $\pm$ 0.9
GW-III-5s	25.6 $\pm$ 1.0	92.2 $\pm$ 1.0	26.5 $\pm$ 1.6	28.9 $\pm$ 0.9	23.4 $\pm$ 0.8	89.6 $\pm$ 0.7	20.7 $\pm$ 0.9
GW-III-5t	16.3 $\pm$ 1.7	18.5 $\pm$ 0.6	19.8 $\pm$ 1.0	5.1 $\pm$ 0.6	3.1 $\pm$ 0.8	6.0 $\pm$ 1.1	6.5 $\pm$ 0.9
GW-III-5u	15.1 $\pm$ 1.0	19.3 $\pm$ 1.7	15.3 $\pm$ 1.7	5.8 $\pm$ 2.1	3.1 $\pm$ 1.6	6.5 $\pm$ 1.6	9.0 $\pm$ 1.5
吡唑醚菌酯	97.9 $\pm$ 1.5	96.6 $\pm$ 0.7	95.9 $\pm$ 0.8	83.8 $\pm$ 0.9	81.3 $\pm$ 1.9	96.9 $\pm$ 0.6	60.2 $\pm$ 0.8
粉唑醇	100	96.1 $\pm$ 0.7	97.1 $\pm$ 2.2	100	99.1 $\pm$ 1.3	95.3 $\pm$ 1.0	95.3 $\pm$ 0.8
噻呋酰胺	67.2 $\pm$ 0.8	32.4 $\pm$ 1.8	100	43.6 $\pm$ 0.6	22.8 $\pm$ 0.6	90.2 $\pm$ 0.6	15.2 $\pm$ 1.7
YZK-C22	84.7 $\pm$ 2.2	82.6 $\pm$ 0.9	83.6 $\pm$ 2.3	82.1 $\pm$ 0.8	71.8 $\pm$ 0.9	93.8 $\pm$ 0.6	81.6 $\pm$ 1.1

[0098] 注:番茄早疫病致病菌,*A.solani* (*A.s*);灰葡萄孢,*B.cinerea* (*B.c*);花生褐斑病菌,*C.arachidicola* (*C.a*);禾谷镰孢菌,*F.graminearum* (*F.g*);苹果轮纹病致病菌,*P.piricola* (*P.p*);立枯丝核菌,*R.solani* (*R.s*);核盘菌,*S.sclerotiorum* (*S.s*)。