(19)国家知识产权局

(12)发明专利申请

(10)申请公布号 CN 117794907 A
(43)申请公布日 2024.03.29

(21)申请号 202280053749.5
(22)申请日 2022.07.25
(30)优先权数据
21189032.2 2021.08.02 EP
(85)PCT国际申请进入国家阶段日
2024.02.01
(86)PCT国际申请的申请数据
PCT/EP2022/070790 2022.07.25
(87)PCT国际申请的公布数据
WO2023/011958 EN 2023.02.09
(71)申请人 巴斯夫欧洲公司
地址 德国
(72)发明人 W·格拉梅诺斯 B·穆勒
P·G·W·泽贝格尔
B·J·梅尔格特 T·A·施特塞尔
R·勒韦佐 J·K·洛曼
D·S·齐格勒 A·米纳卡
N·里迪格 A·科赫
(74)专利代理机构 北京市中咨律师事务所 11247
专利代理师 张振军 刘金辉
(51)Int.Cl.
C07D 401/04(2006.01)
A01N 43/54(2006.01)

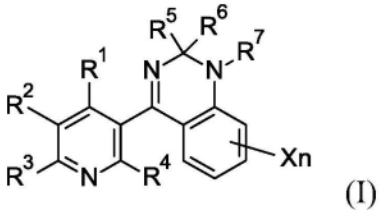
权利要求书2页 说明书91页

(54)发明名称

(3-吡啶基)-喹唑啉

(57)摘要

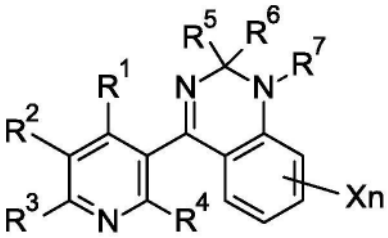
本发明涉及具有式(I)的化合物,其中变量如在说明书和权利要求书中给出的定义。本发明进一步涉及它们的用途和组合物。



(I)

CN 117794907 A

1.作为杀真菌剂的具有式I的化合物及其N-氧化物和农业上可接受的盐



其中

R^1是H、卤素、CN、C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-卤代烷基；

R^2在每种情况下独立地选自卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基、O-C_1-C_6-烷基、O-C_2-C_6-烯基、O-C_2-C_6-炔基、C_3-C_6-环烷基；

R^3在每种情况下独立地选自卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基、O-C_1-C_6-烷基、O-C_2-C_6-烯基、O-C_2-C_6-炔基、C_3-C_6-环烷基；

R^4是H、卤素、CN、C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-卤代烷基；

R^5在每种情况下独立地选自卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基、苯基、苄基，

其中R^5的苯基和苄基部分是未取代的或被一至三个彼此独立地选自以下的基团R^{5a}取代：

卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、O-C_1-C_6-烷基；

R^6在每种情况下独立地选自卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基、苯基、苄基，

其中R^6的苯基和苄基部分是未取代的或被一至三个彼此独立地选自以下的基团R^{6a}取代：

卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、O-C_1-C_6-烷基；

或者

R^5和R^6与它们所键合的C原子一起形成C_3-C_6-环烷基、或含有1、2或3个来自由O和S组成的组的杂原子的3元至6元饱和杂环；

R^7在每种情况下独立地选自氢、CN、CH_2CN、$CH(CH_3)CN$、CH(=O)、C(=O)C_1-C_6-烷基、C(=O)C_2-C_6-烯基、C(=O)C_2-C_6-炔基、C(=O)C_3-C_6-环烷基、C(=O)NH-C_1-C_4-烷基、C(=O)N-(C_1-C_4-烷基)$_2$、C_1-C_6-烷基、O-C_1-C_6-烷基、C_1-C_4-卤代烷基、C_3-C_6-环烷基、C_3-C_6-卤代环烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基、-S(=O)$_2$-R^{7a}、五元或六元杂芳基和芳基或苄基；其中该杂芳基含有一个、两个或三个选自N、O和S的杂原子；其中该芳基和苄基是未取代的或带有一个、两个、三个、四个或五个选自由以下组成的组的取代基：CN、卤素、OH、C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-卤代烷基、C_1-C_4-烷氧基、和C_1-C_4-卤代烷氧基；其中

R^{7a}选自C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基、苯基、苄基，其中苯基和苄基可以是未取代的或被卤素、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基取代；

X在每种情况下独立地选自卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、O-C_1-C_6-烷基、O-C_1-C_6-卤代烷基；

n是0、1、2或3。

2.如权利要求1所述的化合物，其中，R^2是C_1-C_6-烷基。

3.如权利要求1至2中任一项所述的化合物，其中，R^2是CH_3。

4.如权利要求1至3中任一项所述的化合物，其中，R^3选自C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基。

5.如权利要求1至4中任一项所述的化合物，其中，R^3是CH_3或CHF_2。

6.如权利要求1至5中任一项所述的化合物，其中，R^5是C_1-C_6-烷基。

7.如权利要求1至6中任一项所述的化合物，其中，R^6选自C_1-C_6-烷基、苯基、苄基，其中R^5的苯基和苄基部分是未取代的或被一至三个彼此独立地选自以下的基团R^{5a}取代：

卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、O-C_1-C_6-烷基。

8.如权利要求1至5中任一项所述的化合物，其中，R^5和R^6与它们所键合的C原子一起形成C_3-C_6-环烷基。

9.如权利要求1至8中任一项所述的化合物，其中，X选自卤素、C_1-C_6-烷基、O-C_1-C_6-烷基、O-C_1-C_6-卤代烷基。

10.如权利要求1至9中任一项所述的化合物，其中，X选自F、CH_3、C_2H_5、OCH_3、$OCHF_2$、OCF_3。

11.如权利要求1至9中任一项所述的化合物，其中，R^7选自H、CN、C(=O)C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷基、$S(=O)_2$-R^{7a}。

12.一种组合物，该组合物包含一种如权利要求1至11中任一项所定义的具有式I的化合物、其N-氧化物或农业上可接受的盐。

13.一种用于对抗植物病原性真菌的方法，该方法包括用有效量的至少一种如权利要求1至11中任一项所定义的具有式I的化合物、或用如权利要求12中任一项所定义的组合物处理该真菌或待保护以防真菌侵袭的材料、植物、土壤或种子。

14.一种种子，该种子涂覆有0.1至量的至少一种如权利要求1至11中任一项所定义的具有式I的化合物或其农业上可接受的盐、或如权利要求12中任一项所定义的组合物。

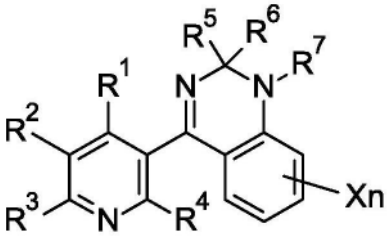
(3-吡啶基)-喹唑啉

[0001] 本发明涉及作为杀真菌剂的(3-吡啶基)-喹唑啉化合物及其N-氧化物和盐,以及它们的用途。本发明还涉及包含至少一种化合物I的组合物、用于对抗植物病原性真菌的方法、以及涂覆有至少一种具有式I的化合物的种子。

[0002] JP 2011148714披露了一些类似的化合物。然而,在许多情况下,特别是在低施用率下,已知化合物的杀真菌活性并不令人满意。基于此,本发明的一个目的是提供对植物病原性真菌具有改善的活性和/或更宽的活性谱的化合物。本发明的另一个目的是提供具有改善的毒理学特性或具有改善的环境归宿特性的杀真菌剂。

[0003] 这些和另外的目的由如以下定义的具有式(I)的吡啶化合物及其农业上适合的实现。

[0004] 因此,本发明涉及作为杀真菌剂的具有式I的化合物及其N-氧化物和农业上可接受的盐

[0005] 

[0006] 其中

[0007] R^1是H、卤素、CN、C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-卤代烷基;

[0008] R^2在每种情况下独立地选自卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基、O-C_1-C_6-烷基、O-C_2-C_6-烯基、O-C_2-C_6-炔基、C_3-C_6-环烷基;

[0009] R^3在每种情况下独立地选自卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基、O-C_1-C_6-烷基、O-C_2-C_6-烯基、O-C_2-C_6-炔基、C_3-C_6-环烷基;

[0010] R^4是H、卤素、CN、C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-卤代烷基;

[0011] R^5在每种情况下独立地选自卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基、苯基、苄基,

[0012] 其中R^5的苯基和苄基部分是未取代的或被一至三个彼此独立地选自以下的基团R^{5a}取代:

[0013] 卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、O-C_1-C_6-烷基;

[0014] R^6在每种情况下独立地选自卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基、苯基、苄基,

[0015] 其中R^6的苯基和苄基部分是未取代的或被一至三个彼此独立地选自以下的基团R^{6a}取代:

[0016] 卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、O-C_1-C_6-烷基;

[0017] 或者

[0018] R^5和R^6与它们所键合的C原子一起形成C_3-C_6-环烷基、或含有1、2或3个来自由O和S组成的组的杂原子的3元至6元饱和杂环；

[0019] R^7在每种情况下独立地选自氢、CN、CH_2CN、$CH(CH_3)CN$、CH(=O)、C(=O)C_1-C_6-烷基、C(=O)C_2-C_6-烯基、C(=O)C_2-C_6-炔基、C(=O)C_3-C_6-环烷基、C(=O)NH-C_1-C_4-烷基、C(=O)N-(C_1-C_4-烷基)$_2$、C_1-C_6-烷基、O-C_1-C_6-烷基、C_1-C_4-卤代烷基、C_3-C_6-环烷基、C_3-C_6-卤代环烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基、-S(=O)$_2$-R^{7a}、五元或六元杂芳基和芳基或苄基；其中该杂芳基含有一个、两个或三个选自N、O和S的杂原子；其中该芳基或苄基是未取代的或带有一个、两个、三个、四个或五个选自由以下组成的组的取代基：CN、卤素、OH、C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-卤代烷基、C_1-C_4-烷氧基、和C_1-C_4-卤代烷氧基；其中

[0020] R^{7a}选自C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基、苯基、苄基，其中苯基和苄基可以是未取代的或被卤素、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基取代；

[0021] X在每种情况下独立地选自卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、O-C_1-C_6-烷基、O-C_1-C_6-卤代烷基；

[0022] n是0、1、2或3。

[0023] N-氧化物可以由本发明的化合物根据常规的氧化方法制备，例如通过用有机过酸如间氯过氧苯甲酸(参见WO 03/64572或J.Med.Chem.[药物化学杂志]38(11),1892-903,1995)；或用无机氧化剂如过氧化氢(参见J.Heterocyc.Chem.[杂环化学杂志]18(7),1305-8,1981)或过硫酸氢钾制剂(参见J.Am.Chem.Soc.[美国化学会志]123(25),5962-5973,2001)处理化合物I。氧化可以产生纯的单-N-氧化物或不同N-氧化物的混合物，其可通过常规方法如色谱法分离。

[0024] 具有式I的化合物的农业上可接受的盐尤其涵盖其阳离子和阴离子分别对化合物I的杀真菌作用没有不利影响的那些阳离子的盐或那些酸的酸加成盐。因此，合适的阳离子特别是碱金属(优选钠和钾)离子，碱土金属(优选钙、镁和钡)离子，过渡金属(优选锰、铜、锌和铁)离子，以及还有铵离子，如果需要，其可以被一至四个C_1-C_4-烷基取代基和/或一个苯基或苄基取代基取代，优选二异丙基铵、四甲基铵、四丁基铵、三甲基苄基铵，此外还有鏻离子，锍离子、优选三(C_1-C_4-烷基)锍，以及氧化锍离子、优选三(C_1-C_4-烷基)氧化锍。

[0025] 可接受的酸加成盐的阴离子主要是氯离子，溴离子，氟离子，硫酸氢根，硫酸根，磷酸二氢根，磷酸氢根，磷酸根，硝酸根，碳酸氢根，碳酸根，六氟硅酸根，六氟磷酸根，苯甲酸根以及C_1-C_4-烷酸的阴离子，优选甲酸根、乙酸根、丙酸根和丁酸根。它们可以通过使化合物I与对应阴离子的酸，优选盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸或硝酸反应来形成。

[0026] 具有式I的化合物可以作为一种或多种立体异构体存在。各种立体异构体包括对映异构体、非对映异构体、由围绕不对称基团的单键受限制旋转产生的阻转异构体和几何异构体。它们也形成本发明的主题的一部分。本领域的技术人员将理解，一种立体异构体当相对于一种或多种其他立体异构体富集时，或当与一种或多种其他立体异构体分离时，可能更有活性和/或可能表现出有益的效果。此外，技术人员知晓如何分离、富集和/或选择性地制备所述立体异构体。本发明的化合物可以作为立体异构体的混合物(例如外消旋物)、单独的立体异构体、或作为光学活性形式存在。

[0027] 具有式I的化合物可以以其生物活性可能不同的不同的晶体变型存在。它们也形

成本发明的主题的一部分。

[0028] 就变量而言,化合物I制备期间获得的中间体的实施例对应于具有式I的化合物的实施例。术语“化合物I”是指具有式I的化合物。

[0029] 在下文中,进一步描述中间体化合物。技术人员将容易理解,本文中结合化合物I给出的取代基的优选项、还特别是下表中对于相应取代基给出的优选项相应地适用于中间体。因此,每种情况下的取代基彼此独立地或更优选以组合的形式具有如本文所定义的含义。

[0030] 如果合成产生异构体的混合物,则通常不一定要求分离,因为在一些情况下单独的异构体可能在为了使用而进行的后处理期间或在施用期间(例如在光、酸或碱的作用下)相互转化。此类转化也可以在使用后发生,例如在植物处理的情况下在被处理的植物中,或者在待控制的有害真菌中。

[0031] 在以上给出的变量的定义中,使用了通常代表所讨论的取代基的集合性术语。术语“C_n-C_m”指示在每种情况下所讨论的取代基或取代基部分中可能的碳原子的数目。

[0032] 术语“卤素”是指氟、氯、溴和碘。

[0033] 术语“C_1-C_6-烷基”是指具有1至6个碳原子的直链或支链饱和烃基,例如甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、已基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基和1-乙基-2-甲基丙基。类似地,术语“C_2-C_4-烷基”是指具有2至4个碳原子的直链或支链烷基,如乙基、丙基(正丙基)、1-甲基乙基(异丙基)、丁基、1-甲基丙基(仲丁基)、2-甲基丙基(异丁基)、1,1-二甲基乙基(叔丁基)。

[0034] 术语“C_1-C_6-卤代烷基”是指如上文所定义的具有1或6个碳原子的烷基,其中这些基团中的一些或全部氢原子可以被如上所述的卤素原子替代。实例是“C_1-C_2-卤代烷基”基团,如氯甲基、溴甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、1-氯乙基、1-溴乙基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、或五氟乙基。

[0035] 术语“C_1-C_6-烷氧基”是指经由氧在烷基中的任意位置上键合的具有1至6个碳原子的直链或支链烷基。实例是“C_1-C_4-烷氧基”基团,如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、1-甲基乙氧基、丁氧基、1-甲基丙氧基、2-甲基丙氧基或1,1-二甲基乙氧基。

[0036] 术语“C_1-C_6-卤代烷氧基”是指如上文所定义的C_1-C_6-烷氧基,其中这些基团中的一些或全部氢原子可以被如上所述的卤素原子替代。实例是“C_1-C_4-卤代烷氧基”基团,如OCH_2F、$OCHF_2$、OCF_3、OCH_2Cl、$OCHCl_2$、$OCCl_3$、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2-溴乙氧基、2-碘乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、OC_2F_5、2-氟丙氧基、3-氟丙氧基、2,2-二氟丙氧基、2,3-二氟丙氧基、2-氯丙氧基、3-氯丙氧基、2,3-二氯丙氧基、2-溴丙氧基、3-溴丙氧基、3,3,3-三氟丙氧基、3,3,3-三氯丙氧基、OCH_2-C_2F_5、

OCF_2-C_2F_5、1-氟甲基-2-氟乙氧基、1-氯甲基-2-氯乙氧基、1-溴甲基-2-溴乙氧基、4-氟丁氧基、4-氯丁氧基、4-溴丁氧基或九氟丁氧基。

[0037] 术语“C_2-C_6-烯基”是指具有2至6个碳原子且在任意位置具有双键的直链或支链不饱和烃基。实例是“C_2-C_4-烯基”基团,如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基(烯丙基)、1-甲基乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基。

[0038] 术语“C_2-C_6-卤代烯基”是指如上文所定义的具有2或6个碳原子的烷基,其中这些基团中的一些或全部氢原子可以被如上所述的卤素原子替代。

[0039] 术语“C_2-C_6-烯氧基”是指经由氧在烯基中的任意位置上键合的具有2至6个碳原子的直链或支链烯基。实例是“C_2-C_4-烯氧基”基团。

[0040] 术语“C_2-C_6-炔基”是指具有2至6个碳原子并且含有至少一个三键的直链或支链不饱和烃基。实例是“C_2-C_4-炔基”基团,例如乙炔基、丙-1-炔基、丙-2-炔基(炔丙基)、丁-1-炔基、丁-2-炔基、丁-3-炔基、1-甲基-丙-2-炔基。

[0041] 术语“C_2-C_6-卤代炔基”是指如上文所定义的具有2或6个碳原子的烷基,其中这些基团中的一些或全部氢原子可以被如上所述的卤素原子替代。

[0042] 术语“C_2-C_6-炔氧基”是指经由氧在炔基中的任意位置上键合的具有2至6个碳原子的直链或支链炔基。实例是“C_2-C_4-炔氧基”基团。

[0043] 术语“C_3-C_6-环烷基”是指具有3至6个碳环成员的单环饱和烃基,如环丙基、环丁基、环戊基、环己基。因此,饱和三元、四元、五元、六元、七元、八元、九元或十元碳环基或碳环是“C_3-C_{10}-环烷基”。

[0044] 术语“C_3-C_6-环烯基”是指具有3至6个碳环成员和至少一个双键的单环部分不饱和3元、4元、5元或6元碳环,如环戊烯基、环戊二烯基、环己二烯基。因此,部分不饱和三元、四元、五元、六元、七元、八元、九元或十元碳环基或碳环是“C_3-C_{10}-环烯基”。

[0045] 术语“C_3-C_8-环烷基-C_1-C_4-烷基”是指具有1至4个碳原子的烷基(如上文所定义),其中烷基的一个氢原子被具有3至8个碳原子的环烷基(如上文所定义)替代。

[0046] 术语“饱和或部分不饱和三元、四元、五元、六元、七元、八元、九元或十元杂环基或杂环,其中该杂环基或杂环含有1、2、3或4个选自N、O和S的杂原子”应理解为意指饱和杂环和部分不饱和的杂环两者,其中杂环的环成员原子除碳原子外还包括1、2、3或4个独立地选自O、N和S的组的杂原子。例如:

[0047] 含有1或2个选自由O、N和S组成的组的杂原子作为环成员的3元或4元饱和杂环,如环氧乙烷、氮丙啶、硫杂环丙烷、氧杂环丁烷、氮杂环丁烷、硫杂环丁烷(thiethane)、[1,2]二氧杂环丁烷、[1,2]二硫杂环丁烷、[1,2]二氮杂环丁烷;以及

[0048] 含有1、2或3个选自由O、N和S组成的组的杂原子作为环成员的5元或6元饱和或部分不饱和杂环,如2-四氢呋喃基、3-四氢呋喃基、2-四氢噻吩基、3-四氢噻吩基、2-吡咯烷基、3-吡咯烷基、3-异噁唑烷基、4-异噁唑烷基、5-异噁唑烷基、3-异噻唑烷基、4-异噻唑烷基、5-异噻唑烷基、3-吡唑烷基、4-吡唑烷基、5-吡唑烷基、2-噁唑烷基、4-噁唑烷基、5-噁唑烷基、2-噻唑烷基、4-噻唑烷基、5-噻唑烷基、2-咪唑烷基、4-咪唑烷基、1,2,4-噁二唑烷-3-基、1,2,4-噁二唑烷-5-基、1,2,4-噻二唑烷-3-基、1,2,4-噻二唑烷-5-基、1,2,4-三唑烷-3-基、1,3,4-噁二唑烷-2-基、1,3,4-噻二唑烷-2-基、1,3,4-三唑烷-2-基、2,3-二氢呋喃-

2-基、2,3-二氢呋喃-3-基、2,4-二氢呋喃-2-基、2,4-二氢呋喃-3-基、2,3-二氢噻吩-2-基、2,3-二氢噻吩-3-基、2,4-二氢噻吩-2-基、2,4-二氢噻吩-3-基、2-吡咯啉-2-基、2-吡咯啉-3-基、3-吡咯啉-2-基、3-吡咯啉-3-基、2-异噁唑啉-3-基、3-异噁唑啉-3-基、4-异噁唑啉-3-基、2-异噁唑啉-4-基、3-异噁唑啉-4-基、4-异噁唑啉-4-基、2-异噁唑啉-5-基、3-异噁唑啉-5-基、4-异噁唑啉-5-基、2-异噻唑啉-3-基、3-异噻唑啉-3-基、4-异噻唑啉-3-基、2-异噻唑啉-4-基、3-异噻唑啉-4-基、4-异噻唑啉-4-基、2-异噻唑啉-5-基、3-异噻唑啉-5-基、4-异噻唑啉-5-基、2,3-二氢吡唑-1-基、2,3-二氢吡唑-2-基、2,3-二氢吡唑-3-基、2,3-二氢吡唑-4-基、2,3-二氢吡唑-5-基、3,4-二氢吡唑-1-基、3,4-二氢吡唑-3-基、3,4-二氢吡唑-4-基、3,4-二氢吡唑-5-基、4,5-二氢吡唑-1-基、4,5-二氢吡唑-3-基、4,5-二氢吡唑-4-基、4,5-二氢吡唑-5-基、2,3-二氢噁唑-2-基、2,3-二氢噁唑-3-基、2,3-二氢噁唑-4-基、2,3-二氢噁唑-5-基、3,4-二氢噁唑-2-基、3,4-二氢噁唑-3-基、3,4-二氢噁唑-4-基、3,4-二氢噁唑-5-基、3,4-二氢噁唑-2-基、3,4-二氢噁唑-3-基、3,4-二氢噁唑-4-基、2-哌啶基、3-哌啶基、4-哌啶基、1,3-二噁烷-5-基、2-四氢吡喃基、4-四氢吡喃基、2-四氢噻吩基、3-六氢哒嗪基、4-六氢哒嗪基、2-六氢嘧啶基、4-六氢嘧啶基、5-六氢嘧啶基、2-哌嗪基、1,3,5-六氢三嗪-2-基和1,2,4-六氢三嗪-3-基,以及还有对应的-亚基基团;以及

[0049] 7元饱和或部分不饱和杂环如四-和六氢氮杂卓基,如2,3,4,5-四氢[1H]氮杂卓-1-、-2-、-3-、-4-、-5-、-6-或-7-基、3,4,5,6-四氢[2H]氮杂卓-2-、-3-、-4-、-5-、-6-或-7-基、2,3,4,7-四氢[1H]氮杂卓-1-、-2-、-3-、-4-、-5-、-6-或-7-基、2,3,6,7-四氢[1H]氮杂卓-1-、-2-、-3-、-4-、-5-、-6-或-7-基、六氢氮杂卓-1-、-2-、-3-或-4-基,四-和六氢氧杂卓基如2,3,4,5-四氢[1H]氧杂卓-2-、-3-、-4-、-5-、-6-或-7-基、2,3,4,7-四氢[1H]氧杂卓-2-、-3-、-4-、-5-、-6-或-7-基、2,3,6,7-四氢[1H]氧杂卓-2-、-3-、-4-、-5-、-6-或-7-基,六氢氮杂卓-1-、-2-、-3-或-4-基,四-和六氢-1,3-二氮杂卓基,四-和六氢-1,4-二氮杂卓基,四-和六氢-1,3-氧氮杂卓基,四-和六氢-1,4-氧氮杂卓基,四-和六氢-1,3-二氧杂卓基,四-和六氢-1,4-二氧杂卓基和对应的-亚基基团。

[0050] 术语“取代的”是指被1、2、3个或最多达可能的最大数量的取代基取代。

[0051] 术语“5元或6元杂芳基”或“5元或6元杂芳族基团(heteroaromatic)”是指除碳原子之外还包含1、2、3或4个独立地选自由N、O和S组成的组的杂原子的芳香族环体系,例如

[0052] 5元杂芳基,如吡咯-1-基、吡咯-2-基、吡咯-3-基、噻吩-2-基、噻吩-3-基、呋喃-2-基、呋喃-3-基、吡唑-1-基、吡唑-3-基、吡唑-4-基、吡唑-5-基、咪唑-1-基、咪唑-2-基、咪唑-4-基、咪唑-5-基、噁唑-2-基、噁唑-4-基、噁唑-5-基、异噁唑-3-基、异噁唑-4-基、异噁唑-5-基、噻唑-2-基、噻唑-4-基、噻唑-5-基、异噻唑-3-基、异噻唑-4-基、异噻唑-5-基、1,2,4-三唑基-1-基、1,2,4-三唑-3-基、1,2,4-三唑-5-基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基和1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基;或者

[0053] 6元杂芳基,如吡啶-2-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、哒嗪-3-基、哒嗪-4-基、嘧啶-2-基、嘧啶-4-基、嘧啶-5-基、吡嗪-2-基和1,3,5-三嗪-2-基和1,2,4-三嗪-3-基。

[0054] 在下文中,描述了本发明化合物的特定实施例。其中,进一步详述了相应取代基的具体含义,其中这些含义在每种情况下其本身而且彼此任意组合是本发明特定实施例。

[0055] 此外,就变量而言,总体上,化合物I的实施例同样适用于中间体。

[0056] 根据具有式I的化合物的一个实施例,R^1是H、卤素、CN、C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-卤代烷

基。

[0057] 根据具有式I的化合物的一个实施例,R^1是H。

[0058] 根据具有式I的化合物的一个实施例,R^1是CH_3。

[0059] 根据具有式I的化合物的一个实施例,R^2选自卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基、O-C_1-C_6-烷基、O-C_2-C_6-烯基、O-C_2-C_6-炔基、C_3-C_6-环烷基。

[0060] 根据式I的还另一个实施例,R^2是卤素,特别是F、Cl、Br或I,更具体地是F、Cl或Br,特别是F或Cl。

[0061] 根据式I的还另一个实施例,R^2是F。

[0062] 根据式I的还另一个实施例,R^2是Cl。

[0063] 根据式I的还另一个实施例,R^2是Br。

[0064] 根据式I的还另一个实施例,R^2是CN。

[0065] 根据式I的还另一个实施例,R^2是C_1-C_6-烷基,特别是C_1-C_4-烷基,如CH_3或C_2H_5,特别是CH_3或CH_2CH_3。

[0066] 根据式I的还另一个实施例,R^2是C_1-C_6-卤代烷基,特别是C_1-C_4-卤代烷基,如CF_3。

[0067] 根据式I的还另一个实施例,R^2是C_2-C_6-烯基,特别是C_2-C_4-烯基,如$CH=CH_2$、$C(CH_3)=CH_2$、$CH_2CH=CH_2$。

[0068] 根据式I的另一个具体实施例,R^2是C_2-C_6-卤代烯基,特别是C_2-C_4-卤代烯基,更具体地C_2-C_3-卤代烯基,如$CH=CHF$、$CH=CHCl$、$CH=CF_2$、$CH=CCl_2$、$CH_2CH=CHF$、$CH_2CH=CHCl$、$CH_2CH=CF_2$、$CH_2CH=CCl_2$、$CF_2CH=CF_2$、$CCl_2CH=CCl_2$、$CF_2CF=CF_2$、$CCl_2CCl=CCl_2$。

[0069] 根据式I的还另一个实施例,R^2是C_2-C_6-炔基或C_2-C_6-卤代炔基,特别是C_2-C_4-炔基或C_2-C_4-卤代炔基,如$C\equiv CH$、$CH_2C\equiv CH$、$C\equiv CCl$、$CH_2C\equiv CCl$、或$CCl_2C\equiv CCl$。

[0070] 根据式I的另一个具体实施例,R^2是O-C_1-C_6-烷基、特别是C_1-C_4-烷基、更具体地C_1-C_2-烷氧基。R^2是如OCH_3或OCH_2CH_3。

[0071] 根据式I的另一个具体实施例,R^2是O-C_1-C_6-烷基。

[0072] 根据式I的另一个具体实施例,R^2是O-C_2-C_6-烯基、特别是C_2-C_4-烯基、更具体地C_2-C_3-烯基。R^2是如$OCH=CH_2$、$OCH_2CH=CH_2$。

[0073] 根据式I的另一个具体实施例,R^2是O-C_2-C_6-炔基、特别是C_2-C_6-炔基、特别是C_2-C_4-炔基、更具体地C_2-C_3-炔基。R^2是如O-CH_2-$C\equiv CH$。

[0074] 根据式I的还另一个实施例,R^2是C_3-C_6-环烷基,特别是环丙基或环丁基。

[0075] 根据本发明的R^2的特别优选的实施例在下表P2中,其中行P2-1至P2-21的每一行对应于本发明的一个特定实施例,其中P2-1至P2-21还彼此任意组合是本发明优选实施例。与R^2键合的碳原子的连接点在图中用“#”标记。

[0076] 表P2:

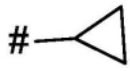
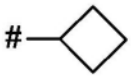
[0077]

编号	R^2
P2-1	CH_3
P2-2	CH_2F
P2-3	CHF_2

编号	R^2
P2-13	OCH_3
P2-14	$OCHF_2$
P2-15	OC_2H_5

[0078]

编号	R^2
P2-4	CF_3
P2-5	C_2H_5
P2-6	$CH(CH_3)_2$
P2-7	$CH_2CH_2CH_3$
P2-8	$CH=CH_2$
P2-9	$CH_2CH=CH_2$
P2-10	C≡CH
P2-11	$CH_2C\equiv CH$
P2-12	OCF_3

编号	R^2
P2-16	CN
P2-17	F
P2-18	Cl
P2-19	Br
P2-20	
P2-21	

[0079] 根据式I的一个实施例，R^3选自由以下组成的组：C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_3-C_6-环烷基，特别是CH_3、C_2H_5、CF_3、CH_2F、CHF_2、环丙基、环丁基，更具体地CH_3、CH_2F、CF_2H、CF_3、环丙基、环丁基，最优选CH_3、CF_3、CF_2H。

[0080] 根据式I的还另一个实施例，R^3是C_1-C_6-烷基，特别是C_1-C_4-烷基，如CH_3或C_2H_5，特别是CH_3或CH_2CH_3。

[0081] 根据式I的还另一个实施例，R^3是C_1-C_6-卤代烷基，特别是C_1-C_4-卤代烷基，如CF_3、FCH_2、F_2CH、CF_3CH_2。

[0082] 根据式I的还另一个实施例，R^3是C_2-C_6-烯基，特别是C_2-C_4-烯基，如$CH=CH_2$、$C(CH_3)=CH_2$、$CH_2CH=CH_2$。

[0083] 根据式I的还另一个实施例，R^3是C_2-C_6-炔基或C_2-C_6-卤代炔基，特别是C_2-C_4-炔基或C_2-C_4-卤代炔基，如$C\equiv CH$、$CH_2C\equiv CH$、$C\equiv CCl$、$CH_2C\equiv CCl$、或$CCl_2C\equiv CCl$。

[0084] 根据式I的另一个具体实施例，R^3是O-C_1-C_6-烷基、特别是C_1-C_4-烷基、更具体地C_1-C_2-烷氧基。R^3是如OCH_3或OCH_2CH_3。

[0085] 根据式I的另一个具体实施例，R^3是O-C_2-C_6-烯基、特别是C_2-C_4-烯基、更具体地C_2-C_3-烯基。R^3是如$OCH=CH_2$、$OCH_2CH=CH_2$。

[0086] 根据式I的另一个具体实施例，R^3是O-C_2-C_6-炔基、特别是C_2-C_6-炔基、特别是C_2-C_4-炔基、更具体地C_2-C_3-炔基。R^3是如O-CH_2-$C\equiv CH$。

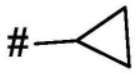
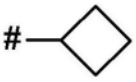
[0087] 根据式I的另一个具体实施例，R^3是O-C_1-C_6-卤代烷基，特别是OCF_3、$OCCl_3$、$OFCH_2$、$OClCH_2$、OF_2CH、OCl_2CH、OCF_3CH_2、$OCCl_3CH_2$或OCF_2CHF_2，更具体地OCF_3、OF_2CH、$OFCH_2$。

[0088] 根据式I的还另一个实施例，R^3是C_3-C_6-环烷基，特别是环丙基、环丁基。

[0089] 根据本发明的R^3的特别优选的实施例在下表P3中，其中行P3-1至P3-17的每一行对应于本发明的一个特定实施例，其中P3-1至P3-17还彼此任意组合是本发明优选实施例。与R^3键合的碳原子的连接点在图中用“#”标记。

[0090] 表P3：

[0091]

编号	R^3
P3-1	CH_3
P3-2	CH_2F
P3-3	CHF_2
P3-4	CF_3
P3-5	C_2H_5
P3-6	$CH(CH_3)_2$
P3-7	$CH_2CH_2CH_3$
P3-8	$CH=CH_2$
P3-9	$CH_2CH=CH_2$
P3-10	$C\equiv CH$
P3-11	$CH_2C\equiv CH$
P3-12	$OCHF_3$
P3-13	OCH_3
P3-14	$OCHF_2$
P3-15	OC_2H_5
P3-16	
P3-17	

[0092] 根据具有式I的化合物的一个实施例，R^4是H、卤素、CN、C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-卤代烷基。

[0093] 根据具有式I的化合物的一个实施例，R^4是H。

[0094] 根据具有式I的化合物的一个实施例，R^4是CH_3。

[0095] R^5在每种情况下独立地选自卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基、C_1-C_6-烷基-O-C_1-C_6-烷基、苯基、苄基，

[0096] 其中R^5的苯基和苄基部分是未取代的或被一至三个彼此独立地选自以下的基团R^{5a}取代：

[0097] 卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、O-C_1-C_6-烷基。

[0098] 根据具有式I的化合物的一个实施例，R^5在每种情况下独立地选自C_1-C_6-烷基(实施例5.1)、C_1-C_6-卤代烷基(实施例5.2)、C_1-C_6-烷基-O-C_1-C_6-烷基(实施例5.3)、苯基、CH_2-苯基(实施例5.4)、卤素(实施例5.5)，其中苯基和CH_2-苯基是未取代的或被一个或两个卤素取代。

[0099] 根据具有式I的化合物的一个另外的实施例，R^5是CH_3或CF_3。

[0100] 根据具有式I的化合物的一个另外的实施例,R^5是CH_2CH_3、$CH(CH_3)_2$、$CH(CH_3)CH_2CH_3$、$C(CH_3)_3$、CH_2-$CH(CH_3)_2$、CH_2-$C(CH_3)_3$、CH_2-O-CH_3。

[0101] 根据具有式I的化合物的一个另外的实施例,R^5是苯基、2-F-苯基、4-F-苯基、2,4-F_2-苯基、2-Cl-苯基、4-Cl-苯基、CH_2-苯基、CH_2-2-F-苯基、CH_2-4-F-苯基。

[0102] 根据具有式I的化合物的一个实施例,R^6在每种情况下独立地选自在每种情况下独立地选自卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基、C_1-C_6-烷基-O-C_1-C_6-烷基、苯基、苄基、C_1-C_6-烷基-O-苯基,

[0103] 其中R^6的苯基和苄基部分是未取代的或被一至三个彼此独立地选自以下的基团R^{6a}取代:

[0104] 卤素、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、O-C_1-C_6-烷基。

[0105] 根据具有式I的化合物的一个实施例,R^6在每种情况下独立地选自C_1-C_6-烷基(实施例6.1)、C_1-C_6-烷基-O-苯基(实施例6.2)、C_1-C_6-烷基-O-C_1-C_6-烷基(实施例6.3)、卤素(实施例6.4)。

[0106] 根据具有式I的化合物的一个另外的实施例,R^6是CH_3或CF_3。

[0107] 根据具有式I的化合物的一个另外的实施例,R^6是CH_2CH_3、$CH(CH_3)_2$、$CH(CH_3)CH_2CH_3$、$C(CH_3)_3$、CH_2-$CH(CH_3)_2$、CH_2-$C(CH_3)_3$、CH_2-$CH(CH_3)$-$C(CH_3)_3$、CH_2-CH_2-C(CH3)$_3$、CH_2-O-CH_3、CH_2-O-$(CH_3)_3$、CH_2-O-苯基。

[0108] 根据具有式I的化合物的一个另外的实施例,R^5和R^6与它们所键合的C原子一起形成C_3-C_6-环烷基、或含有1、2或3个来自由O和S组成的组的杂原子的3元至6元饱和杂环。

[0109] 根据具有式I的化合物的一个另外的实施例,R^5和R^6形成C_3-C_6-环烷基(实施例6.5)。

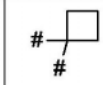
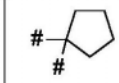
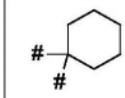
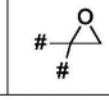
[0110] 根据具有式I的化合物的一个另外的实施例,R^5和R^6形成含有1、2或3个来自由O和S组成的组的杂原子的3元至6元饱和杂环。

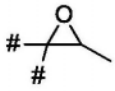
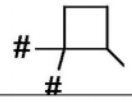
[0111] 根据具有式I的化合物的一个另外的实施例,R^5和R^6形成含有一个O的3元至6元饱和杂环(实施例6.6)。

[0112] 根据本发明的R^5、R^6的优选实施例在下表P5中,其中行P5-1至P5-18的每一行对应于本发明的一个特定实施例,其中P5-1至P5-18还彼此任意组合是本发明优选实施例。与R^5和R^6键合的碳原子的连接点在图中用“#”标记。

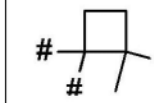
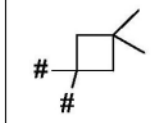
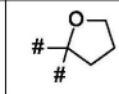
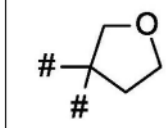
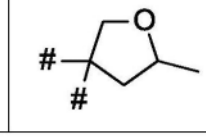
[0113] 表P5,6:

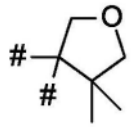
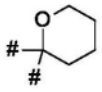
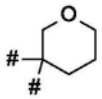
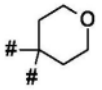
[0114]

编号	R^5	R^6
P5-1		
P5-2		
P5-3		
P5-4		
P5-5		

编号	R^5	R^6
P5-6		
P5-7		
P5-8		
P5-9		

[0115]

编号	R^5	R^6
P5-10		
P5-11		
P5-12		
P5-13		
P5-14		

编号	R^5	R^6
P5-15		
P5-16		
P5-17		
P5-18		

[0116] R^7在每种情况下独立地选自氢、CN、CH_2CN、$CH(CH_3)CN$、CH(=O)、C(=O)C_1-C_6-烷基、C(=O)C_2-C_6-烯基、C(=O)C_2-C_6-炔基、C(=O)C_3-C_6-环烷基、C(=O)NH-C_1-C_4-烷基、C(=O)N-(C_1-C_4-烷基)$_2$、C_1-C_6-烷基、O-C_1-C_6-烷基、C_1-C_4-卤代烷基、C_3-C_6-环烷基、C_3-C_6-卤代环烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基、-S(=O)$_2$-R^{7a}、五元或六元杂芳基和芳基;其中该杂芳基含有一个、两个或三个选自N、O和S的杂原子;其中该芳基是未取代的或带有一个、两个、三个、四个或五个选自由以下组成的组的取代基:CN、卤素、OH、C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-卤代烷基、C_1-C_4-烷氧基、和C_1-C_4-卤代烷氧基;其中

[0117] R^{7a}选自C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基、苯基、苄基,其中苯基和苄基可以是未取代的或被卤素、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-卤代烯基、C_2-C_6-炔基、C_2-C_6-卤代炔基取代。

[0118] 根据式I的一个实施例,R^7是H。

[0119] 根据式I的还另一个实施例,R^7是Cl、F。

[0120] 根据式I的还另一个实施例,R^7是CN、CH_2CN、或$CH(CH_3)CN$。

[0121] 根据式I的另一个具体实施例,R^7是CH(=O)。

[0122] 根据式I的另一个具体实施例,R^7是OCH_3或OCH_2CH_3。

[0123] 根据式I的另一个具体实施例,R^7是C(=O)C_1-C_6-烷基,其中烷基是CH_3、C_2H_5、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、正戊基、或异戊基。

[0124] 根据式I的另一个具体实施例,R^7是C(=O)C_2-C_6-烯基,其中烯基是$CH=CH_2$、$CH_2CH=CH_2$。

[0125] 根据式I的另一个具体实施例,R^7是C(=O)C_2-C_6-炔基,其中炔基是$C\equiv CH$、$CH_2C\equiv CH$。

[0126] 根据式I的另一个具体实施例,R^7是C(=O)C_3-C_6-环烷基,其中环烷基是环丙基(C_3H_7)或环丁基(C_4H_9)。

[0127] 根据式I的另一个具体实施例,R^7是C(=O)NH-C_1-C_4-烷基或C(=O)N-(C_1-C_4-烷基)$_2$,其中烷基是CH_3、C_2H_5、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基。

[0128] 根据式I的还另一个实施例,R^7是C_1-C_6-烷基,如CH_3、C_2H_5、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、正戊基或异戊基。

[0129] 根据式I的还另一个实施例,R^7是C_1-C_6-烷基、特别是C_1-C_4-烷基,如CH_3、C_2H_5、正丙基、异丙基。

[0130] 根据式I的还另一个实施例,R^7是C_1-C_6-卤代烷基,特别是C_1-C_4-卤代烷基,如CF_3、CCl_3、FCH_2、$ClCH_2$、F_2CH、Cl_2CH、CF_3CH_2、CCl_3CH_2或CF_2CHF_2。

[0131] 根据式I的还另一个实施例,R^7是C_3-C_6-环烷基、特别是环丙基。

[0132] 根据式I的还另一个实施例,R^7是C_3-C_6-卤代环烷基。在特殊实施例中,R^{5b}是完全或部分卤代的环丙基,如1-F-环丙基、1-Cl-环丙基、1,1-F_2-环丙基、1,1-Cl_2-环丙基。

[0133] 根据式I的还另一个实施例,R^7是C_2-C_6-烯基,特别是C_2-C_4-烯基,如$CH=CH_2$、$C(CH_3)=CH_2$、$CH_2CH=CH_2$。

[0134] 根据式I的另一个具体实施例,R^7是C_2-C_6-卤代烯基,特别是C_2-C_4-卤代烯基,更具体地C_2-C_3-卤代烯基,如$CH=CHF$、$CH=CHCl$、$CH=CF_2$、$CH=CCl_2$、$CH_2CH=CHF$、$CH_2CH=CHCl$、$CH_2CH=CF_2$、$CH_2CH=CCl_2$、$CF_2CH=CF_2$、$CCl_2CH=CCl_2$、$CF_2CF=CF_2$、$CCl_2CCl=CCl_2$。

[0135] 根据式I的还另一个实施例,R^7是C_2-C_6-炔基或C_2-C_6-卤代炔基,特别是C_2-C_4-炔基或C_2-C_4-卤代炔基,如$C\equiv CH$、$CH_2C\equiv CH$。

[0136] 根据式I的还另一个实施例,R^7是-S(=O)$_2$-R^{7a},其中R^{7a}优选地是C_1-C_6-烷基,特别是C_1-C_4-烷基,如CH_3、C_2H_5、正丙基、异丙基。

[0137] 根据式I的还另一个实施例,R^7是芳基,特别是苯基,其中该芳基或苯基部分在每种情况下是未取代的或被相同或不同的彼此独立地选自以下的基团R^{5b}取代:卤素、C_1-C_2-烷基、C_1-C_2-烷氧基、C_1-C_2-卤代烷基和C_1-C_2-卤代烷氧基,特别是F、Cl、Br、CH_3、OCH_3、CF_3、和OCF_3。根据一个实施例,R^5是未取代的苯基。根据另一个实施例,R^5是被一个、两个、三个(特别是一个)特别是选自F、Cl和Br、更具体地选自F和Cl的卤素取代的苯基。

[0138] 根据式I的还另一个实施例,R^7是5元杂芳基,如吡咯-1-基、吡咯-2-基、吡咯-3-基、噻吩-2-基、噻吩-3-基、呋喃-2-基、呋喃-3-基、吡唑-1-基、吡唑-3-基、吡唑-4-基、吡

唑-5-基、咪唑-1-基、咪唑-2-基、咪唑-4-基、咪唑-5-基、噁唑-2-基、噁唑-4-基、噁唑-5-基、异噁唑-3-基、异噁唑-4-基、异噁唑-5-基、噻唑-2-基、噻唑-4-基、噻唑-5-基、异噻唑-3-基、异噻唑-4-基、异噻唑-5-基、1,2,4-三唑基-1-基、1,2,4-三唑-3-基、1,2,4-三唑-5-基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基和1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基。

[0139] 根据式I的还另一个实施例,R^7是6元杂芳基,如吡啶-2-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、哒嗪-3-基、哒嗪-4-基、嘧啶-2-基、嘧啶-4-基、嘧啶-5-基、吡嗪-2-基和1,3,5-三嗪-2-基和1,2,4-三嗪-3-基。

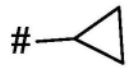
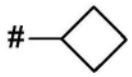
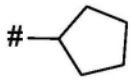
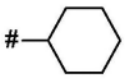
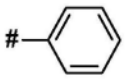
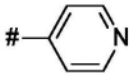
[0140] 根据式I的还另一个实施例,R^7在每种情况下独立地选自H、卤素、OH、CN、C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-卤代烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-炔基、C_1-C_6-烷氧基、C_1-C_6-卤代烷氧基、C_3-C_6-烯氧基、C_3-C_6-炔氧基和C_3-C_6-环烷基,其中R^5的非环状部分是未取代的或被相同或不同的如所定义的并且优选如本文所定义的基团R^{5a}取代,并且其中R^5的碳环、苯基和杂芳基部分是未取代的或被相同或不同的如所定义的并且优选如本文所定义的基团R^{5b}取代。

[0141] 根据本发明的R^7的特别优选的实施例在下表P7中,其中行P7-1至P7-32的每一行对应于本发明的一个特定实施例,其中P7-1至P7-32还彼此任意组合是本发明优选实施例。与R^7键合的碳原子的连接点在图中用“#”标记。

[0142] 表P5:

[0143]

编号	R^5
P7-1	H
P7-2	CH_3
P7-3	CH_2F
P7-4	CHF_2
P7-5	CF_3
P7-6	C_2H_5
P7-7	C_3H_7
P7-8	$CH(CH_3)_2$
P7-9	$CH_2CH_2CH_3$
P7-10	$CH_2CH_2CH_2CH_3$
P7-11	$CH_2CH(CH_3)_2$
P7-12	$C(CH_3)_3$
P7-13	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
P7-14	$CH=CH_2$
P7-15	$CH_2CH=CH_2$
P7-16	CΞCH
P7-17	CH_2CΞCH
P7-18	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
P7-19	CN

编号	R^5
P7-20	CH_2CN
P7-21	$CH(CH_3)CN$
P7-22	CH(=O)
P7-23	$C(=O)CH_3$
P7-24	$C(=O)NH\text{-}CH_3$
P7-25	$C(=O)N(CH_3)_2$
P7-26	$S(=O)_2\text{-}CH_3$
P7-27	
P7-28	
P7-29	
P7-30	
P7-31	
P7-32	

[0144] 根据具有式I的化合物的一个实施例,X在每种情况下独立地选自卤素(实施例X.1)、CN、C_1-C_6-烷基(实施例X.2)、C_1-C_6-卤代烷基(实施例X.3)、O-C_1-C_6-烷基(实施例X.4)、O-C_1-C_6-卤代烷基(实施例X.5)。

[0145] 根据具有式I的化合物的一个实施例,X在每种情况下独立地选自卤素、O-C_1-C_6-烷基。

[0146] 根据具有式I的化合物的一个实施例,X在每种情况下独立地选自F或Cl。

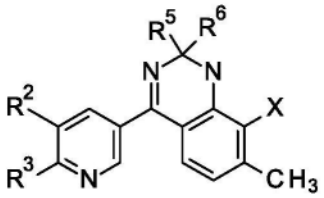
[0147] 根据具有式I的化合物的一个实施例,X是C_3-C_6-环烷基。

[0148] 根据具有式I的化合物的一个实施例,n是0。

[0149] 根据具有式I的化合物的一个实施例,n是1。

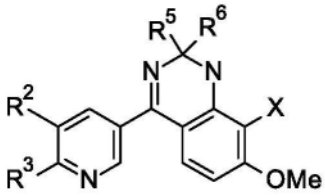
[0150] 根据具有式I的化合物的一个实施例,n是2。

[0151] 根据一个实施例,Xn如下文所定义:

[0152] 

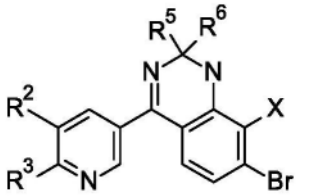
[0153] 并且X选自F、Cl、I、CH_3、环丙基、CH=CH_2、C≡CH、OCH_3、$OCHF_2$、CF_3、CHF_2、CH_2CH_3、CN。

[0154] 根据一个实施例,Xn如下文所定义:

[0155] 

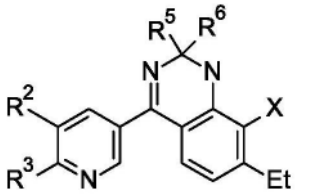
[0156] 并且X选自F、Cl、I、CH_3、环丙基、CH=CH_2、C≡CH、OCH_3、$OCHF_2$、CF_3、CHF_2、CH_2CH_3、CN。

[0157] 根据一个实施例,Xn如下文所定义:

[0158] 

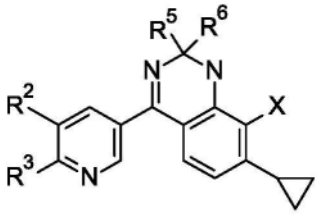
[0159] 并且X选自F、Cl、I、CH_3、环丙基、CH=CH_2、C≡CH、OCH_3、$OCHF_2$、CF_3、CHF_2、CH_2CH_3、CN。

[0160] 根据一个实施例,Xn如下文所定义:

[0161] 

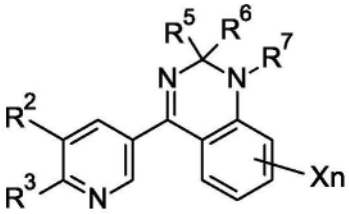
[0162] 并且X选自F、Cl、I、CH_3、环丙基、CH=CH_2、C≡CH、OCH_3、$OCHF_2$、CF_3、CHF_2、CH_2CH_3、CN。

[0163] 根据一个实施例,Xn如下文所定义:

[0164] 

[0165] 并且X选自F、Cl、I、CH_3、环丙基、CH=CH_2、C≡CH、OCH_3、$OCHF_2$、CF_3、CHF_2、CH_2CH_3、CN。

[0166] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.275,其表示上文针对变量R^2、R^3和X(由实施例X.1至X.6表示)中的每一个所定义的实施例的优选组合,具有式I的化合物中的n如下所定义。

[0167] 

[0168] 表E：

[0169]

实施例	X	n	R^2	R^3
E.1	（X.1）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-烷基

[0170]

实施例	X	n	R^2	R^3
E.2	（X.2）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-烷基
E.3	（X.3）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-烷基
E.4	（X.4）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-烷基
E.5	（X.5）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-烷基
E.6	（X.1）	0、1 或 2	卤素	C_1-C_6-烷基
E.7	（X.2）	0、1 或 2	卤素	C_1-C_6-烷基
E.8	（X.3）	0、1 或 2	卤素	C_1-C_6-烷基
E.9	（X.4）	0、1 或 2	卤素	C_1-C_6-烷基
E.10	（X.5）	0、1 或 2	卤素	C_1-C_6-烷基
E.11	（X.1）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_1-C_6-烷基
E.12	（X.2）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_1-C_6-烷基
E.13	（X.3）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_1-C_6-烷基
E.14	（X.4）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_1-C_6-烷基
E.15	（X.5）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_1-C_6-烷基
E.16	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-烷基
E.17	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-烷基
E.18	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-烷基
E.19	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-烷基
E.20	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-烷基
E.21	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_1-C_6-烷基
E.22	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_1-C_6-烷基
E.23	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_1-C_6-烷基
E.24	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_1-C_6-烷基
E.25	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_1-C_6-烷基
E.26	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-烷基
E.27	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-烷基

[0171]

实施例	X	n	R^2	R^3
E.28	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-烷基
E.29	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-烷基
E.30	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-烷基
E.31	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_1-C_6-烷基
E.32	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_1-C_6-烷基
E.33	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_1-C_6-烷基
E.34	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_1-C_6-烷基
E.35	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_1-C_6-烷基
E.36	（X.1）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-烷基
E.37	（X.2）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-烷基
E.38	（X.3）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-烷基
E.39	（X.4）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-烷基
E.40	（X.5）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-烷基
E.41	（X.1）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-烷基
E.42	（X.2）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-烷基
E.43	（X.3）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-烷基
E.44	（X.4）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-烷基
E.45	（X.5）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-烷基
E.46	（X.1）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-烷基
E.47	（X.2）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-烷基
E.48	（X.3）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-烷基
E.49	（X.4）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-烷基
E.50	（X.5）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-烷基
E.51	（X.1）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_1-C_6-烷基
E.52	（X.2）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_1-C_6-烷基
E.53	（X.3）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_1-C_6-烷基

[0172]

实施例	X	n	R^2	R^3
E.54	（X.4）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_1-C_6-烷基
E.55	（X.5）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_1-C_6-烷基
E.56	（X.1）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.57	（X.2）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.58	（X.3）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.59	（X.4）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.60	（X.5）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.61	（X.1）	0、1 或 2	卤素	C_1-C_6-卤代烷基
E.62	（X.2）	0、1 或 2	卤素	C_1-C_6-卤代烷基
E.63	（X.3）	0、1 或 2	卤素	C_1-C_6-卤代烷基
E.64	（X.4）	0、1 或 2	卤素	C_1-C_6-卤代烷基
E.65	（X.5）	0、1 或 2	卤素	C_1-C_6-卤代烷基
E.66	（X.1）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.67	（X.2）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.68	（X.3）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.69	（X.4）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.70	（X.5）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.71	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-卤代烷基
E.72	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-卤代烷基
E.73	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-卤代烷基
E.74	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-卤代烷基
E.75	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-卤代烷基
E.76	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_1-C_6-卤代烷基
E.77	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_1-C_6-卤代烷基
E.78	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_1-C_6-卤代烷基
E.79	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_1-C_6-卤代烷基

[0173]

实施例	X	n	R^2	R^3
E.80	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_1-C_6-卤代烷基
E.81	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-卤代烷基
E.82	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-卤代烷基
E.83	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-卤代烷基
E.84	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-卤代烷基
E.85	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-卤代烷基
E.86	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_1-C_6-卤代烷基
E.87	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_1-C_6-卤代烷基
E.88	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_1-C_6-卤代烷基
E.89	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_1-C_6-卤代烷基
E.90	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_1-C_6-卤代烷基
E.91	（X.1）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.92	（X.2）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.93	（X.3）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.94	（X.4）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.95	（X.5）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.96	（X.1）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-卤代烷基
E.97	（X.2）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-卤代烷基
E.98	（X.3）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-卤代烷基
E.99	（X.4）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-卤代烷基
E.100	（X.5）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_1-C_6-卤代烷基
E.101	（X.1）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-卤代烷基
E.102	（X.2）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-卤代烷基
E.103	（X.3）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-卤代烷基
E.104	（X.4）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-卤代烷基
E.105	（X.5）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_1-C_6-卤代烷基

[0174]

实施例	X	n	R^2	R^3
E.106	（X.1）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.107	（X.2）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.108	（X.3）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.109	（X.4）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.110	（X.5）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_1-C_6-卤代烷基
E.111	（X.1）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.112	（X.2）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.113	（X.3）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.114	（X.4）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.115	（X.5）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.116	（X.1）	0、1 或 2	卤素	O-C_1-C_6-烷基
E.117	（X.2）	0、1 或 2	卤素	O-C_1-C_6-烷基
E.118	（X.3）	0、1 或 2	卤素	O-C_1-C_6-烷基
E.119	（X.4）	0、1 或 2	卤素	O-C_1-C_6-烷基
E.120	（X.5）	0、1 或 2	卤素	O-C_1-C_6-烷基
E.121	（X.1）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.122	（X.2）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.123	（X.3）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.124	（X.4）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.125	（X.5）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.126	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	O-C_1-C_6-烷基
E.127	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	O-C_1-C_6-烷基
E.128	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	O-C_1-C_6-烷基
E.129	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	O-C_1-C_6-烷基
E.130	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	O-C_1-C_6-烷基
E.131	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	O-C_1-C_6-烷基

[0175]

实施例	X	n	R^2	R^3
E.132	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	O-C_1-C_6-烷基
E.133	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	O-C_1-C_6-烷基
E.134	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	O-C_1-C_6-烷基
E.135	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	O-C_1-C_6-烷基
E.136	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	O-C_1-C_6-烷基
E.137	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	O-C_1-C_6-烷基
E.138	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	O-C_1-C_6-烷基
E.139	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	O-C_1-C_6-烷基
E.140	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	O-C_1-C_6-烷基
E.141	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	O-C_1-C_6-烷基
E.142	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	O-C_1-C_6-烷基
E.143	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	O-C_1-C_6-烷基
E.144	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	O-C_1-C_6-烷基
E.145	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	O-C_1-C_6-烷基
E.146	（X.1）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.147	（X.2）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.148	（X.3）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.149	（X.4）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.150	（X.5）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.151	（X.1）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	O-C_1-C_6-烷基
E.152	（X.2）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	O-C_1-C_6-烷基
E.153	（X.3）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	O-C_1-C_6-烷基
E.154	（X.4）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	O-C_1-C_6-烷基
E.155	（X.5）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	O-C_1-C_6-烷基
E.156	（X.1）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	O-C_1-C_6-烷基
E.157	（X.2）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	O-C_1-C_6-烷基

[0176]

实施例	X	n	R^2	R^3
E.158	（X.3）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	O-C_1-C_6-烷基
E.159	（X.4）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	O-C_1-C_6-烷基
E.160	（X.5）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	O-C_1-C_6-烷基
E.161	（X.1）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.162	（X.2）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.163	（X.3）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.164	（X.4）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.165	（X.5）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	O-C_1-C_6-烷基
E.166	（X.1）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_3-C_6-环烷基
E.167	（X.2）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_3-C_6-环烷基
E.168	（X.3）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_3-C_6-环烷基
E.169	（X.4）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_3-C_6-环烷基
E.170	（X.5）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_3-C_6-环烷基
E.171	（X.1）	0、1 或 2	卤素	C_3-C_6-环烷基
E.172	（X.2）	0、1 或 2	卤素	C_3-C_6-环烷基
E.173	（X.3）	0、1 或 2	卤素	C_3-C_6-环烷基
E.174	（X.4）	0、1 或 2	卤素	C_3-C_6-环烷基
E.175	（X.5）	0、1 或 2	卤素	C_3-C_6-环烷基
E.176	（X.1）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_3-C_6-环烷基
E.177	（X.2）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_3-C_6-环烷基
E.178	（X.3）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_3-C_6-环烷基
E.179	（X.4）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_3-C_6-环烷基
E.180	（X.5）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_3-C_6-环烷基
E.181	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_3-C_6-环烷基
E.182	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_3-C_6-环烷基
E.183	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_3-C_6-环烷基

[0177]

实施例	X	n	R^2	R^3
E.184	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_3-C_6-环烷基
E.185	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_3-C_6-环烷基
E.186	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_3-C_6-环烷基
E.187	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_3-C_6-环烷基
E.188	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_3-C_6-环烷基
E.189	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_3-C_6-环烷基
E.190	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_3-C_6-环烷基
E.191	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_3-C_6-环烷基
E.192	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_3-C_6-环烷基
E.193	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_3-C_6-环烷基
E.194	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_3-C_6-环烷基
E.195	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_3-C_6-环烷基
E.196	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_3-C_6-环烷基
E.197	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_3-C_6-环烷基
E.198	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_3-C_6-环烷基
E.199	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_3-C_6-环烷基
E.200	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_3-C_6-环烷基
E.201	（X.1）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_3-C_6-环烷基
E.202	（X.2）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_3-C_6-环烷基
E.203	（X.3）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_3-C_6-环烷基
E.204	（X.4）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_3-C_6-环烷基
E.205	（X.5）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_3-C_6-环烷基
E.206	（X.1）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_3-C_6-环烷基
E.207	（X.2）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_3-C_6-环烷基
E.208	（X.3）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_3-C_6-环烷基
E.209	（X.4）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_3-C_6-环烷基

[0178]

实施例	X	n	R^2	R^3
E.210	（X.5）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_3-C_6-环烷基
E.211	（X.1）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_3-C_6-环烷基
E.212	（X.2）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_3-C_6-环烷基
E.213	（X.3）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_3-C_6-环烷基
E.214	（X.4）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_3-C_6-环烷基
E.215	（X.5）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_3-C_6-环烷基
E.216	（X.1）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_3-C_6-环烷基
E.217	（X.2）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_3-C_6-环烷基
E.218	（X.3）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_3-C_6-环烷基
E.219	（X.4）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_3-C_6-环烷基
E.220	（X.5）	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_3-C_6-环烷基
E.221	（X.1）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_2-C_6-烯基
E.222	（X.2）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_2-C_6-烯基
E.223	（X.3）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_2-C_6-烯基
E.224	（X.4）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_2-C_6-烯基
E.225	（X.5）	0、1 或 2	C_1-C_6-烷基	C_2-C_6-烯基
E.226	（X.1）	0、1 或 2	卤素	C_2-C_6-烯基
E.227	（X.2）	0、1 或 2	卤素	C_2-C_6-烯基
E.228	（X.3）	0、1 或 2	卤素	C_2-C_6-烯基
E.229	（X.4）	0、1 或 2	卤素	C_2-C_6-烯基
E.230	（X.5）	0、1 或 2	卤素	C_2-C_6-烯基
E.231	（X.1）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_2-C_6-烯基
E.232	（X.2）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_2-C_6-烯基
E.233	（X.3）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_2-C_6-烯基
E.234	（X.4）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_2-C_6-烯基
E.235	（X.5）	0、1 或 2	C_1-C_6-卤代烷基	C_2-C_6-烯基

[0179]

实施例	X	n	R^2	R^3
E.236	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_2-C_6-烯基
E.237	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_2-C_6-烯基
E.238	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_2-C_6-烯基
E.239	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_2-C_6-烯基
E.240	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-烯基	C_2-C_6-烯基
E.241	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_2-C_6-烯基
E.242	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_2-C_6-烯基
E.243	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_2-C_6-烯基
E.244	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_2-C_6-烯基
E.245	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代烯基	C_2-C_6-烯基
E.246	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_2-C_6-烯基
E.247	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_2-C_6-烯基
E.248	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_2-C_6-烯基
E.249	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_2-C_6-烯基
E.250	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-炔基	C_2-C_6-烯基
E.251	（X.1）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_2-C_6-烯基
E.252	（X.2）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_2-C_6-烯基
E.253	（X.3）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_2-C_6-烯基
E.254	（X.4）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_2-C_6-烯基
E.255	（X.5）	0、1 或 2	C_2-C_6-卤代炔基	C_2-C_6-烯基
E.256	（X.1）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_2-C_6-烯基
E.257	（X.2）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_2-C_6-烯基
E.258	（X.3）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_2-C_6-烯基
E.259	（X.4）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_2-C_6-烯基
E.260	（X.5）	0、1 或 2	O-C_1-C_6-烷基	C_2-C_6-烯基
E.261	（X.1）	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_2-C_6-烯基

[0180]

实施例	X	n	R^2	R^3
E.262	(X.2)	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_2-C_6-烯基
E.263	(X.3)	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_2-C_6-烯基
E.264	(X.4)	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_2-C_6-烯基
E.265	(X.5)	0、1 或 2	O-C_2-C_6-烯基	C_2-C_6-烯基
E.266	(X.1)	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_2-C_6-烯基
E.267	(X.2)	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_2-C_6-烯基
E.268	(X.3)	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_2-C_6-烯基
E.269	(X.4)	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_2-C_6-烯基
E.270	(X.5)	0、1 或 2	O-C_2-C_6-炔基	C_2-C_6-烯基
E.271	(X.1)	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_2-C_6-烯基
E.272	(X.2)	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_2-C_6-烯基
E.273	(X.3)	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_2-C_6-烯基
E.274	(X.4)	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_2-C_6-烯基
E.275	(X.5)	0、1 或 2	C_3-C_6-环烷基	C_2-C_6-烯基

[0181] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.1表示,并且R^6由实施例6.1表示。

[0182] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.2表示,并且R^6由实施例6.1表示。

[0183] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.3表示,并且R^6由实施例6.1表示。

[0184] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.4表示,并且R^6由实施例6.1表示。

[0185] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.5表示,并且R^6由实施例6.1表示。

[0186] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.1表示,并且R^6由实施例6.2表示。

[0187] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.2表示,并且R^6由实施例6.2表示。

[0188] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.3表示,并且R^6由实施例6.2表示。

[0189] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.4表示,并且R^6由实施例6.2表示。

[0190] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.5

表示,并且R^6由实施例6.2表示。

[0191] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.1表示,并且R^6由实施例6.3表示。

[0192] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.2表示,并且R^6由实施例6.3表示。

[0193] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.3表示,并且R^6由实施例6.3表示。

[0194] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.4表示,并且R^6由实施例6.3表示。

[0195] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.5表示,并且R^6由实施例6.3表示。

[0196] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.1表示,并且R^6由实施例6.4表示。

[0197] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.2表示,并且R^6由实施例6.4表示。

[0198] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.3表示,并且R^6由实施例6.4表示。

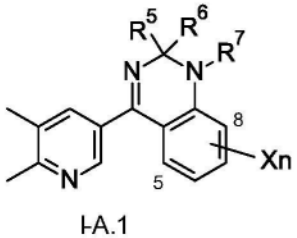
[0199] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.4表示,并且R^6由实施例6.4表示。

[0200] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5由实施例5.5表示,并且R^6由实施例6.4表示。

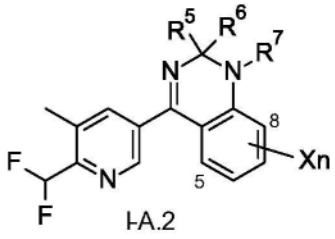
[0201] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5和R^6由实施例6.5表示。

[0202] 在另外的方面,本发明涉及表E中列出的实施例E.1至E.280,其中R^5和R^6由实施例6.6表示。

[0203] 本发明的优选实施例是以下化合物I.A-1、I.A-2、I.A-3、I.A-4。在这些式中,取代基R^5、R^6和Xn独立地如上文所定义或优选地如本文所定义:

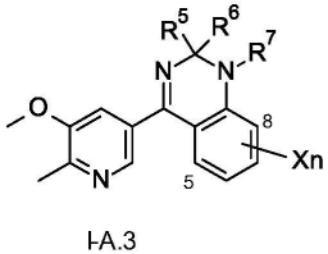


I-A.1

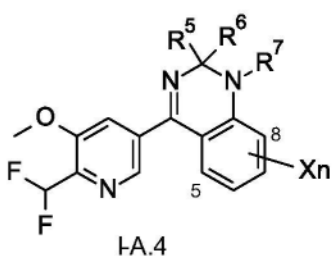


I-A.2

[0204]



I-A.3



I-A.4

[0205] 特别地,考虑到它们的用途,根据一个实施例,优选的是化合物I.A-1、I.A-2、I.A-

3、I.A-4中的化合物;其汇编于表1a至7a中。此外,在表中对于取代基提及的每个基团本身(独立于提及的组合)是所述取代基的特别优选的方面。

[0206] 表1a具有式I.A-1、I.A-2、I.A-3、I.A-4的化合物,其中Xn是H,并且每种单独的化合物的R^5、R^6和R^7的组合的含义在每种情况下对应于表B中的一行(化合物I.A-1.1a.B-1至I.A-1.1a.B-100、I.A-2.1a.B-1至I.A-2.1a.B-100、I.A-3.1a.B-1至I.A-3.1a.B-100、I.A-4.1a.B-1至I.A-4.1a.B-100)。

[0207] 表2a具有式I.A-1、I.A-2、I.A-3、I.A-4的化合物;其中Xn是8-F,并且每种单独的化合物的R^5、R^6和R^7的组合的含义在每种情况下对应于表B中的一行(化合物I.A-1.2a.B-1至I.A-1.2a.B-100、I.A-2.2a.B-1至I.A-2.2a.B-100、I.A-3.2a.B-1至I.A-3.2a.B-100、I.A-4.2a.B-1至I.A-4.2a.B-100)。

[0208] 表3a具有式I.A-1、I.A-2、I.A-3、I.A-4的化合物;其中Xn是8-Cl,并且每种单独的化合物的R^5、R^6和R^7的组合的含义在每种情况下对应于表B中的一行(化合物I.A-1.3a.B-1至I.A-1.3a.B-100、I.A-2.3a.B-1至I.A-2.3a.B-100、I.A-3.3a.B-1至I.A-3.3a.B-100、I.A-4.3a.B-1至I.A-4.3a.B-100)。

[0209] 表4a具有式I.A-1、I.A-2、I.A-3、I.A-4的化合物;其中Xn是8-CH_3,并且每种单独的化合物的R^5、R^6和R^7的组合的含义在每种情况下对应于表B中的一行(化合物I.A-1.4a.B-1至I.A-1.4a.B-100、I.A-2.4a.B-1至I.A-2.4a.B-100、I.A-3.4a.B-1至I.A-3.4a.B-100、I.A-4.4a.B-1至I.A-4.4a.B-100)。

[0210] 表5a具有式I.A-1、I.A-2、I.A-3、I.A-4的化合物;其中Xn是7,8-F_2,并且每种单独的化合物的R^5、R^6和R^7的组合的含义在每种情况下对应于表B中的一行(化合物I.A-1.5a.B-1至I.A-1.5a.B-100、I.A-2.5a.B-1至I.A-2.5a.B-100、I.A-3.5a.B-1至I.A-3.5a.B-100、I.A-4.5a.B-1至I.A-4.5a.B-100)。

[0211] 表6a具有式I.A-1、I.A-2、I.A-3、I.A-4的化合物;其中Xn是8-OCH_3,并且每种单独的化合物的R^5、R^6和R^7的组合的含义在每种情况下对应于表B中的一行(化合物I.A-1.6a.B-1至I.A-1.6a.B-100、I.A-2.6a.B-1至I.A-2.6a.B-100、I.A-3.6a.B-1至I.A-3.6a.B-100、I.A-4.6a.B-1至I.A-45.6a.B-100)。

[0212] 表7a具有式I.A-1、I.A-2、I.A-3、I.A-4的化合物;其中Xn是7-F-8-OCH_3,并且每种单独的化合物的R^5、R^6和R^7的组合的含义在每种情况下对应于表B中的一行(化合物I.A-1.7a.B-1至I.A-1.7a.B-100、I.A-2.7a.B-1至I.A-2.7a.B-100、I.A-3.7a.B-1至I.A-3.7a.B-100、I.A-4.7a.B-1至I.A-4.7a.B-100)。

[0213] 表B

[0214]

编号	R^7	R^5	R^6
B-1	H	CH_3	CH_3

[0215]

编号	R^7	R^5	R^6
B-2	CH_3	CH_3	CH_3
B-3	C_2H_5	CH_3	CH_3
B-4	CN	CH_3	CH_3
B-5	OCH_3	CH_3	CH_3
B-6	CH_2CN	CH_3	CH_3
B-7	CHO	CH_3	CH_3
B-8	$CH_2CH_2CH_3$	CH_3	CH_3
B-9	$C(CH_3)_3$	CH_3	CH_3
B-10	$CH_2C(CH_3)_3$	CH_3	CH_3
B-11	H	C_2H_5	CH_3
B-12	CH_3	C_2H_5	CH_3
B-13	C_2H_5	C_2H_5	CH_3
B-14	CN	C_2H_5	CH_3
B-15	OCH_3	C_2H_5	CH_3
B-16	CH_2CN	C_2H_5	CH_3
B-17	CHO	C_2H_5	CH_3
B-18	$CH_2CH_2CH_3$	C_2H_5	CH_3
B-19	$C(CH_3)_3$	C_2H_5	CH_3
B-20	$CH_2C(CH_3)_3$	C_2H_5	CH_3
B-21	H	$C(CH_3)_3$	CH_3
B-22	CH_3	$C(CH_3)_3$	CH_3
B-23	C_2H_5	$C(CH_3)_3$	CH_3
B-24	CN	$C(CH_3)_3$	CH_3
B-25	OCH_3	$C(CH_3)_3$	CH_3
B-26	CH_2CN	$C(CH_3)_3$	CH_3
B-27	CHO	$C(CH_3)_3$	CH_3

[0216]

编号	R^7	R^5	R^6
B-28	$CH_2CH_2CH_3$	$C(CH_3)_3$	CH_3
B-29	$C(CH_3)_3$	$C(CH_3)_3$	CH_3
B-30	$CH_2C(CH_3)_3$	$C(CH_3)_3$	CH_3
B-31	H	CH_3	C_2H_5
B-32	CH_3	CH_3	C_2H_5
B-33	C_2H_5	CH_3	C_2H_5
B-34	CN	CH_3	C_2H_5
B-35	OCH_3	CH_3	C_2H_5
B-36	CH_2CN	CH_3	C_2H_5
B-37	CHO	CH_3	C_2H_5
B-38	$CH_2CH_2CH_3$	CH_3	C_2H_5
B-39	$C(CH_3)_3$	CH_3	C_2H_5
B-40	$CH_2C(CH_3)_3$	CH_3	C_2H_5
B-41	H	C_2H_5	C_2H_5
B-42	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
B-43	C_2H_5	C_2H_5	C_2H_5
B-44	CN	C_2H_5	C_2H_5
B-45	OCH_3	C_2H_5	C_2H_5
B-46	CH_2CN	C_2H_5	C_2H_5
B-47	CHO	C_2H_5	C_2H_5
B-48	$CH_2CH_2CH_3$	C_2H_5	C_2H_5
B-49	$C(CH_3)_3$	C_2H_5	C_2H_5
B-50	$CH_2C(CH_3)_3$	C_2H_5	C_2H_5
B-51	H	$C(CH_3)_3$	C_2H_5
B-52	CH_3	$C(CH_3)_3$	C_2H_5
B-53	C_2H_5	$C(CH_3)_3$	C_2H_5

[0217]

编号	R^7	R^5	R^6
B-54	CN	$C(CH_3)_3$	C_2H_5
B-55	OCH_3	$C(CH_3)_3$	C_2H_5
B-56	CH_2CN	$C(CH_3)_3$	C_2H_5
B-57	CHO	$C(CH_3)_3$	C_2H_5
B-58	$CH_2CH_2CH_3$	$C(CH_3)_3$	C_2H_5
B-59	$C(CH_3)_3$	$C(CH_3)_3$	C_2H_5
B-60	$CH_2C(CH_3)_3$	$C(CH_3)_3$	C_2H_5
B-61	H	CH_3	$C(CH_3)_3$
B-62	CH_3	CH_3	$C(CH_3)_3$
B-63	C_2H_5	CH_3	$C(CH_3)_3$
B-64	CN	CH_3	$C(CH_3)_3$
B-65	OCH_3	CH_3	$C(CH_3)_3$
B-66	CH_2CN	CH_3	$C(CH_3)_3$
B-67	CHO	CH_3	$C(CH_3)_3$
B-68	$CH_2CH_2CH_3$	CH_3	$C(CH_3)_3$
B-69	$C(CH_3)_3$	CH_3	$C(CH_3)_3$
B-70	$CH_2C(CH_3)_3$	CH_3	$C(CH_3)_3$
B-71	H	C_2H_5	$C(CH_3)_3$
B-72	CH_3	C_2H_5	$C(CH_3)_3$
B-73	C_2H_5	C_2H_5	$C(CH_3)_3$
B-74	CN	C_2H_5	$C(CH_3)_3$
B-75	OCH_3	C_2H_5	$C(CH_3)_3$
B-76	CH_2CN	C_2H_5	$C(CH_3)_3$
B-77	CHO	C_2H_5	$C(CH_3)_3$
B-78	$CH_2CH_2CH_3$	C_2H_5	$C(CH_3)_3$
B-79	$C(CH_3)_3$	C_2H_5	$C(CH_3)_3$

[0218]

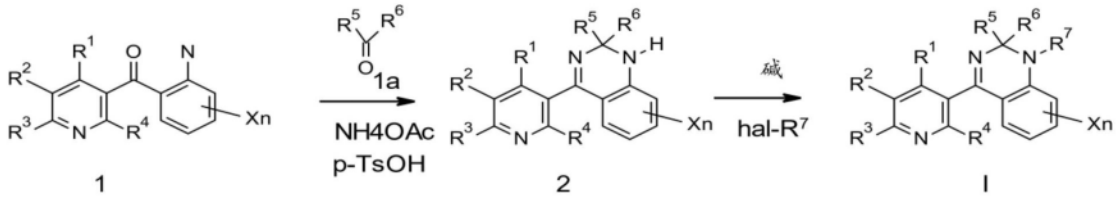
编号	R^7	R^5	R^6
B-80	$CH_2C(CH_3)_3$	C_2H_5	$C(CH_3)_3$
B-81	H	$C(CH_3)_3$	$C(CH_3)_3$
B-82	CH_3	$C(CH_3)_3$	$C(CH_3)_3$
B-83	C_2H_5	$C(CH_3)_3$	$C(CH_3)_3$
B-84	CN	$C(CH_3)_3$	$C(CH_3)_3$
B-85	OCH_3	$C(CH_3)_3$	$C(CH_3)_3$
B-86	CH_2CN	$C(CH_3)_3$	$C(CH_3)_3$
B-87	CHO	$C(CH_3)_3$	$C(CH_3)_3$
B-88	$CH_2CH_2CH_3$	$C(CH_3)_3$	$C(CH_3)_3$
B-89	$C(CH_3)_3$	$C(CH_3)_3$	$C(CH_3)_3$
B-90	$CH_2C(CH_3)_3$	$C(CH_3)_3$	$C(CH_3)_3$
B-91	H	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$	
B-92	CH_3	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$	
B-93	C_2H_5	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$	
B-94	CN	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$	
B-95	OCH_3	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$	
B-96	CH_2CN	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$	
B-97	CHO	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$	
B-98	$CH_2CH_2CH_3$	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$	
B-99	$C(CH_3)_3$	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$	
B-100	$CH_2C(CH_3)_3$	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$	

[0219] 本发明的化合物可以如在以下方案中所示来制造,其中除非另外说明,否则每一变量的定义是如上文针对具有式I的化合物所定义的。具有式I的化合物可以根据现有技术中描述的方法或类似于现有技术中描述的方法来制备。合成利用了可商购或者可以根据常规程序从容易获得的化合物开始制备的起始材料。

[0220] 例如,由具有式2的化合物形成化合物I适合在碱如钾或钠的低级醇盐或氢化物存在下通过烷基化或酰化进行。二低级烷基硫酸酯也可用于实现所述烷基化或酰化,如US 3,625,959中所述。

[0221] 具有式2的环状化合物可以由酮胺化合物1通过与具有式1a的酮或醛在乙酸铵存

在下反应来制备。在一些情况下,酸如对甲苯磺酸(p-TsOH)、对甲苯磺酸吡啶鎓、硫酸或乙酸的存在提高了产率(对于先例,参见例如Chemistry Select[化学选择](2018),3(32),9388-9392和Organic&Biomolecular Chemistry[有机与生物分子化学](2003),1(2),367-372)。

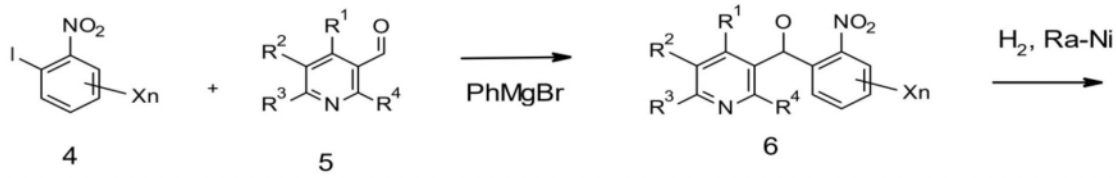
[0222] 

[0223] 化合物1是可商购的或者可以按照以下方案1中概述的一般途径通过使用例如二氧化锰氧化氨基醇7来获得,如Inorganica Chimica Acta[无机化学学报](2012),382,72-78,WO 2000038618,CN 107879989 A,Chinese Science Bulletin[科学通报](2010),55(25),2817-2819中所述。

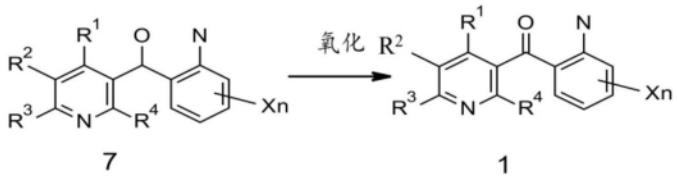
[0224] 具有式7的化合物可以通过使用RANEY®-镍催化氢化相应的硝基醇6来获得,如WO 2000038618,Inorganica Chimica Acta[无机化学学报](2012),382,72-78中所述。

[0225] 2-硝基醇6可以如Knochel和同事所述(Angew.Chem.,Int.Ed.[德国应用化学国际版],2002,41,1610)由4通过苯基溴化镁介导的NO_2邻位的碘-镁交换并且随后与可商购的苯甲醛衍生物5加成来制备。

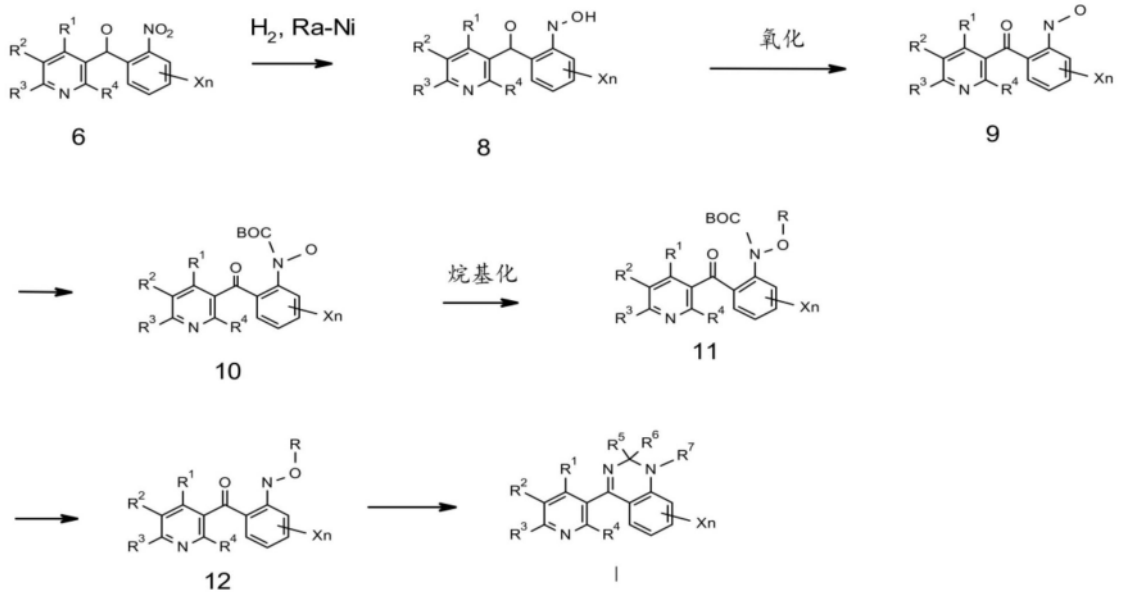
[0226] 方案1



[0227]



[0228] 具有式I的化合物(其中R^7是烷氧基)可以由6通过以下合成路线制备,该合成路线的特征在于如RSC Advances[英国皇家化学会研究进展](2020),28585-28594中所述使用通过氨水和DMSO的组合液处理后的钝化的RANEY®-镍或如IN1996CH00112中所述使用铂碳(类型F 103RS/W,来自德固赛公司(Degussa))将硝基醇6选择性催化氢化成对应的N-芳基羟胺8。

[0229] 

[0230] 具有式9的化合物可以通过使用例如二氧化锰氧化羟基-胺醇8来制备,如Inorganica Chimica Acta[无机化学学报](2012),382,72-78和WO 2000038618中所述。

[0231] 受保护的羟胺10可以通过文献中众所周知的用于氨基保护基团的方法来制备,这些氨基保护基团如Theodora W.Greene的书“Protective Groups in Organic Synthesis[有机合成中的保护基团]”中所论述的,如在适当溶剂(如DMSO)中使用二碳酸二叔丁酯的N-Boc。

[0232] 可以使用标准碱如LDA、NaH或NaHMDS将化合物10烷基化以使羟胺去质子化,然后在适当溶剂中加成具有适当离去基团(如卤化物、甲磺酸酯或三氟甲磺酸酯)的烷基化剂以提供化合物11(对于先例,参见例如CN 207973751)。

[0233] 可以通过许多文献中众所周知的方法,如在二氯甲烷中的TFA,除去N-Boc保护基团得到化合物12(对于先例,参见例如WO 2000038618)。

[0234] 最后,可以由12通过用NH_4OAc处理来制备其中R^7是烷氧基的化合物I,如Chemistry Select[化学选择](2018),3(32),9388-9392和Organic&Biomolecular Chemistry[有机与生物分子化学](2003),1(2),367-372中所述。

[0235] 化合物I及其组合物分别适合作为杀真菌剂,有效对抗广谱植物病原性真菌,包括土壤传播的真菌,特别是来自根肿菌纲、卵菌纲(Peronosporomycetes)(同义词Oomycetes)、壶菌纲、接合菌纲、子囊菌纲、担子菌纲和半知菌纲(同义词不完全菌纲(Fungiimperfecti))的真菌。它们在作物保护中可以用作叶面杀真菌剂、拌种用杀真菌剂和土壤杀真菌剂。

[0236] 化合物I及其组合物优选地可用于控制以下上的植物病原性真菌:各种栽培植物,如谷物,例如小麦、黑麦、大麦、黑小麦、燕麦或稻;甜菜,如糖用甜菜或饲用甜菜;水果,例如梨果(苹果、梨等)、核果(例如李子、桃、杏仁、樱桃)或软果,也称为浆果(草莓、覆盆子、黑莓、醋栗等);豆科植物,如扁豆、豌豆、苜蓿或大豆;油料植物,如油菜、芥菜、橄榄、向日葵、椰子、可可豆、蓖麻油植物、油棕榈、落花生或大豆;瓜类,例如南瓜、黄瓜或甜瓜;纤维植物,例如棉花、亚麻、大麻、或黄麻;柑橘类水果,如橙子、柠檬、葡萄柚或橘子;蔬菜,例如菠菜、莴苣、芦笋、卷心菜、胡萝卜、洋葱、番茄、马铃薯、葫芦或红辣椒;月桂科植物,如鳄梨、肉桂

或樟脑;能源和原料植物,例如玉米、大豆、油菜、甘蔗或油棕榈;玉米;烟草;坚果;咖啡;茶;香蕉;葡萄藤(食用葡萄和葡萄汁葡萄藤);啤酒花;草皮;甜叶(也称为甜叶菊);天然橡胶植物;或观赏植物和森林植物,如花卉、灌木、阔叶树或常绿树(针叶树、桉树等);植物繁殖材料如种子;以及这些植物的作物材料。

[0237] 更优选地,化合物I及其组合物分别用于控制以下上的真菌:大田作物如马铃薯、糖用甜菜、烟草、小麦、黑麦、大麦、燕麦、稻、玉米、棉花、大豆、油菜、豆类、向日葵、咖啡或甘蔗;水果;藤本植物;观赏植物;或蔬菜,如黄瓜、番茄、菜豆或南瓜。

[0238] 术语“植物繁殖材料”应理解为表示植物的所有有生殖能力的部分,例如种子;以及可用于植物繁殖的营养植物材料,如插条和块茎(如马铃薯)。这包括植物的种子、根、果实、块茎、鳞茎、根茎、嫩枝、芽和其他部分;包括发芽后或出土后进行移植的籽苗和幼苗。

[0239] 优选地,分别用化合物I及其组合物处理植物繁殖材料用于控制以下上的真菌:谷物如小麦、黑麦、大麦和燕麦;稻、玉米、棉花和大豆。

[0240] 根据本发明,所有以上栽培植物应理解为包括所有属于相应栽培植物的物种、亚种、变种、品种和/或杂种,包括但不限于冬季和春季品种,特别是谷类如小麦和大麦,以及油菜,例如冬小麦、春小麦、冬大麦等。

[0241] 玉米也称为印度玉米或玉蜀黍(maize/Zea mays),其包括所有种类的玉米如饲料玉米和甜玉米。根据本发明,包括所有玉蜀黍或玉米亚种和/或变种,特别是粉质玉米(玉蜀黍粉质型变种(Zea mays var.amylacea))、爆粒玉米(玉蜀黍爆粒型变种(Zea mays var.everta))、马齿玉米(玉蜀黍马齿型变种(Zea mays var.indentata))、硬粒玉米(玉蜀黍硬粒型变种(Zea mays var.indurata))、甜玉米(玉蜀黍saccharata和rugosa变种(Zea mays var.saccharata和var.rugosa))、糯玉米(玉蜀黍ceratina变种(Zea mays var.ceratina))、高直链淀粉玉米(amylomaize)(高直链淀粉玉蜀黍品种)、荚玉米或野生玉蜀黍(玉蜀黍tunicata变种(Zea mays var.tunicata))和条纹玉蜀黍(玉蜀黍japonica变种(Zea mays var.japonica))。

[0242] 大多数大豆栽培品种可分为无限和有限生长习性,而野大豆(Glycine soja)(大豆的野生祖先)是无限的(PNAS2010,107(19)8563-856)。无限生长习性(成熟组,MG 00至MG 4.9)的特征在于在开花开始后营养生长的持续,而有限大豆品种(MG 5至MG 8)特征性地在开花开始时已经完成了大部分其营养生长。根据本发明包括所有大豆栽培品种或品种,特别是无限和有限栽培品种或品种。

[0243] 术语“栽培植物”应理解为包括已经通过诱变或基因工程修饰以便对植物提供新性状或者修饰已经存在的性状的植物。诱变包括使用X射线或致突变化学品的随机诱变,而且包括靶向诱变,以在植物基因组的特定基因座产生突变。靶向诱变经常使用寡核苷酸或蛋白质如CRISPR/Cas、锌指核酸酶、TALEN或大范围核酸酶。基因工程通常使用重组DNA技术在植物基因组中产生修饰,这种修饰在自然环境下不能通过杂交、诱变或自然重组轻易得到。典型地,将一个或多个基因整合到植物的基因组中以便增加性状或改善或修饰性状。这些整合的基因也称为转基因,而包含此类转基因的植物被称为转基因植物。植物转化过程通常产生若干个转化事件,它们在其中已经整合了转基因的基因组基因座上不同。在特定基因组基因座上包含特定转基因的植物通常被描述为包含特定“事件”,其由特定事件名称来指代。已经引入植物中或已经修饰的性状包括除草剂耐受性、昆虫抗性、提高的产量、以

及对非生物条件如干旱的耐受性。

[0244] 除草剂耐受性已经通过使用诱变和基因工程产生。已经通过诱变和育种致使对乙酰乳酸合酶(ALS)抑制剂除草剂耐受的植物是例如以名称Clearfield®可获得。已经通过使用转基因产生了对草甘膦、草铵膦、2,4-D、麦草畏、苯腈(oxynil)除草剂(如溴苯腈和碘苯腈)、磺酰脲除草剂、ALS抑制剂以及4-羟基苯基丙酮酸双加氧酶(HPPD)抑制剂(像异噁唑草酮和硝磺草酮)的除草剂耐受性。

[0245] 提供除草剂耐受性性状的转基因包括:对于草甘膦耐受性:cp4epsps、epsps grg23ace5、mepsps、2mepsps、gat4601、gat4621、goxv247;对于草铵膦耐受性:pat和bar,对于2,4-D耐受性:aad-1、aad-12;对于麦草畏耐受性:dmo;对于苯腈除草剂耐受性:bxn;对于磺酰脲除草剂耐受性:zm-hra、csr1-2、gm-hra、S4-HrA;对于ALS抑制剂耐受性:csr1-2;以及对于HPPD抑制剂耐受性:hppdPF、W336、avhppd-03。

[0246] 包含除草剂耐受性基因的转基因玉米事件包括但不限于DAS40278、MON801、MON802、MON809、MON810、MON832、MON87411、MON87419、MON87427、MON88017、MON89034、NK603、GA21、MZHG0JG、HCEM485、VCO-Ø1981-5、676、678、680、33121、4114、59122、98140、Bt10、Bt176、CBH-351、DBT418、DLL25、MS3、MS6、MZIR098、T25、TC1507和TC6275。包含除草剂耐受性基因的转基因大豆事件包括但不限于GTS 40-3-2、MON87705、MON87708、MON87712、MON87769、MON89788、A2704-12、A2704-21、A5547-127、A5547-35、DP356043、DAS44406-6、DAS68416-4、DAS-81419-2、GU262、SYHTØH2、W62、W98、FG72和CV127。包含除草剂耐受性基因的转基因棉花事件包括但不限于19-51a、31707、42317、81910、281-24-236、3006-210-23、BXN10211、BXN10215、BXN10222、BXN10224、MON1445、MON1698、MON88701、MON88913、GHB119、GHB614、LLCotton25、T303-3和T304-40。包含除草剂耐受性基因的转基因卡诺拉事件是例如,但不排除其他,MON88302、HCR-1、HCN10、HCN28、HCN92、MS1、MS8、PHY14、PHY23、PHY35、PHY36、RF1、RF2和RF3。

[0247] 提供昆虫抗性的转基因优选是芽孢杆菌属(Bacillus)物种的毒素基因及其合成变体,如cry1A、cry1Ab、cry1Ab-Ac、cry1Ac、cry1A.105、cry1F、cry1Fa2、cry2Ab2、cry2Ae、mcry3A、ecry3.1Ab、cry3Bb1、cry34Ab1、cry35Ab1、cry9C、vip3A(a)、vip3Aa20。此外,可以使用植物来源的转基因,如编码蛋白酶抑制剂的基因,如CpTI和pinII。另一种途径使用转基因如dvsnf7在植物中产生双链RNA。

[0248] 包含杀昆虫蛋白基因或双链RNA的转基因玉米事件包括但不限于Bt10、Bt11、Bt176、MON801、MON802、MON809、MON810、MON863、MON87411、MON88017、MON89034、33121、4114、5307、59122、TC1507、TC6275、CBH-351、MIR162、DBT418和MZIR098。包含杀昆虫蛋白基因的转基因大豆事件包括但不限于MON87701、MON87751和DAS-81419。包含杀昆虫蛋白基因的转基因棉花事件包括但不限于SGK321、MON531、MON757、MON1076、MON15985、31707、31803、31807、31808、42317、BNLA-601、Event1、COT67B、COT102、T303-3、T304-40、GFM Cry1A、GK12、MLS 9124、281-24-236、3006-210-23、GHB119和SGK321。

[0249] 已经通过使用转基因athb17(例如玉米事件MON87403)或bbx32(例如大豆事件MON87712)产生了具有提高的产量的栽培植物。

[0250] 包含改良的油含量的栽培植物已经通过使用以下转基因产生:gm-fad2-1、

Pj.D6D、Nc.Fad3、fad2-1A和fatb1-A(例如大豆事件260-05、MON87705和MON87769)。

[0251] 对非生物条件(如干旱)的耐受性已经通过使用转基因cspB(玉米事件MON87460)和Hahb-4(大豆事件IND-ØØ41Ø-5)产生。

[0252] 通常通过在转化事件中将基因组合或者通过在育种过程期间将不同事件组合而将性状组合,从而产生具有叠加性状的栽培植物。性状的优选组合是对不同组的除草剂的除草剂耐受性性状的组合,对不同种类的昆虫的昆虫耐受性、特别是对鳞翅目和鞘翅目昆虫的耐受性的组合,除草剂耐受性与一种或若干种类型的昆虫抗性的组合,除草剂耐受性与提高的产量的组合,以及除草剂耐受性和对非生物条件的耐受性的组合。

[0253] 包含单一或叠加性状的植物以及提供这些性状的基因和事件在本领域是众所周知的。例如,有关诱变或整合基因和相应事件的详细信息从机构“国际农业生物技术应用服务组织(ISAAA)”(http://www.isaaa.org/gmapprovaldatabase)和“环境风险评估中心(CERA)”(http://cera-gmc.org/GMCropDatabase)的网站可获得。有关特定事件和检测这些事件的方法的另外的信息,对于卡诺拉(canola)事件MS1、MS8、RF3、GT73、MON88302、KK179,可见于WO 01/031042、WO 01/041558、WO 01/041558、WO 02/036831、WO 11/153186、WO 13/003558;对于棉花事件MON1445、MON15985、MON531(MON15985)、LLCotton25、MON88913、COT102、281-24-236、3006-210-23、COT67B、GHB614、T304-40、GHB119、MON88701、81910,可见于WO 02/034946、WO 02/100163、WO 02/100163、WO 03/013224、WO 04/072235、WO 04/039986、WO 05/103266、WO 05/103266、WO 06/128573、WO 07/017186、WO 08/122406、WO 08/151780、WO 12/134808、WO 13/112527;对于玉米事件GA21、MON810、DLL25、TC1507、MON863、MIR604、LY038、MON88017、3272、59122、NK603、MIR162、MON89034、98140、32138、MON87460、5307、4114、MON87427、DAS40278、MON87411、33121、MON87403、MON87419,可见于WO 98/044140、US 02/102582、US 03/126634、WO 04/099447、WO 04/011601、WO 05/103301、WO 05/061720、WO 05/059103、WO 06/098952、WO 06/039376、US2007/292854、WO 07/142840、WO 07/140256、WO 08/112019、WO 09/103049、WO 09/111263、WO 10/077816、WO 11/084621、WO 11/062904、WO 11/022469、WO 13/169923、WO 14/116854、WO 15/053998、WO 15/142571;对于马铃薯事件E12、F10、J3、J55、V11、X17、Y9,可见于WO 14/178910、WO 14/178913、WO 14/178941、WO 14/179276、WO 16/183445、WO 17/062831、WO 17/062825;对于稻事件LLRICE06、LLRICE601、LLRICE62,可见于WO 00/026345、WO 00/026356、WO 00/026345;并且对于大豆事件H7-1、MON89788、A2704-12、A5547-127、DP305423、DP356043、MON87701、MON87769、CV127、MON87705、DAS68416-4、MON87708、MON87712、SYHT0H2、DAS81419、DAS81419 x DAS44406-6、MON87751,可见于WO 04/074492、WO 06/130436、WO 06/108674、WO 06/108675、WO 08/054747、WO 08/002872、WO 09/064652、WO 09/102873、WO 10/080829、WO 10/037016、WO 11/066384、WO 11/034704、WO 12/051199、WO 12/082548、WO 13/016527、WO 13/016516、WO 14/201235。

[0254] 在栽培植物上分别使用化合物I及其组合物可以导致对包含某个转基因或事件的栽培植物具有特异性的效果。这些效果可能涉及生长行为的改变或改变的对生物或非生物胁迫因素的抗性。此类效果特别可能包括提高的产量,提高的对昆虫、线虫、真菌、细菌、支原体、病毒或类病毒病原体的抗性或耐受性以及早期生长势(early vigour)、早熟或延迟成熟、冷或热耐受性以及改变的氨基酸或脂肪酸谱或含量。

[0255] 化合物I及其组合物分别特别适用于控制以下植物病害的致病病原:

[0256] 观赏植物、蔬菜(例如,白锈菌(A.candida))和向日葵(例如婆罗门参白锈菌(A.tragopogonis))上的白锈菌属(Albugo)物种(白锈病);蔬菜(例如,胡萝卜链格孢(A.dauci)或葱链格孢(A.porri))、油菜(甘蓝链格孢(A.brassicicola)或芸苔链格孢(A.brassicae))、糖用甜菜(细链格孢(A.tenuis))、水果(例如柚链格孢(A.grandis))、稻、大豆、马铃薯和番茄(例如茄链格孢、柚链格孢或互隔链格孢(A.alternata))、番茄(例如茄链格孢或互隔链格孢)、和小麦(例如小麦链格孢(A.triticina))上的链格孢属(Alternaria)物种(链格孢叶斑病);糖用甜菜和蔬菜上的丝囊霉属(Aphanomyces)物种;谷物和蔬菜上的壳二孢属(Ascochyta)物种,例如小麦上的小麦壳二孢(A.tritici)(炭疽病)和大麦上的大麦壳二孢(A.hordei);玉米上的玉米短柄霉(Aureobasidium zeae)(同义词Kapatiella zeae);平脐蠕孢属(Bipolaris)物种和内脐蠕孢属(Drechslera)物种(有性型:旋孢腔菌属(Cochliobolus)物种),例如玉米上的小斑病(玉蜀黍内脐蠕孢(D.maydis))或大斑病(玉米平脐蠕孢(B.zeicola)),例如谷物上的斑枯病(麦根腐平脐蠕孢(B.sorokiniana))以及例如稻和坪草上的稻平脐蠕孢(B.oryzae);谷物上(例如小麦或大麦上)的禾本科布氏白粉菌(Blumeria graminis)

[0257] (之前称为禾生白粉菌(Erysiphe graminis))(白粉病);水果和浆果

[0258] (例如草莓)、蔬菜(例如莴苣、胡萝卜、芹菜和卷心菜)、洋葱家族

[0259] (葱鳞葡萄孢(B.squamosa)或葱腐葡萄孢(B.allii))、油菜、观赏植物(例如椭圆葡萄孢(B eliptica))、藤本植物、森林植物和小麦上的灰葡萄孢(Botrytis cinerea)(有性型:富氏葡萄核盘菌(Botryotinia fuckeliana):灰霉病);莴苣上的莴苣盘梗霉(Bremia lactucae)(霜霉病);阔叶树和常绿树上的长喙壳属(Ceratocystis)(同义词Ophiostoma)物种(腐病或萎蔫),例如榆树上的榆长喙壳(C.ulmi)(荷兰榆树病

[0260] (Dutch elm disease));玉米(例如灰斑病:玉蜀黍尾孢(C.zeae-maydis))、稻、糖用甜菜(例如甜菜生尾孢(C.beticola))、甘蔗、蔬菜、咖啡、大豆(例如大豆尾孢(C.sojina)或菊池尾孢(C.kikuchii))和稻上的尾孢属(Cercospora)物种(尾孢菌叶斑(Cercospora leaf spot));蘑菇上的指孢霉属(Cladobotryum)(同义词Dactylium)物种(例如嗜菌指孢霉(C.mycophilum)(之前称为树状指孢霉(Dactylium dendroides),有性型:Nectria albertinii,粉红寄生菌(Nectria rosella)同义词Hypomyces rosellus);番茄(例如黄枝孢(C.fulvum):叶霉病)和谷物上的枝孢属(Cladosporium)物种,例如小麦上的多主枝孢(C.herbarum)(黑穗病(black ear));谷物上的麦角菌(Claviceps purpurea)(麦角病

[0261] (ergot));玉米(炭色旋孢腔菌(C.carbonum))、谷物(例如禾旋孢腔菌(C.sativus),无性型:麦根腐平脐蠕孢(B.sorokiniana))和稻(例如宫部旋孢腔菌(C.miyabeanus),无性型:稻长蠕孢(H.oryzae))上的旋孢腔菌属(Cochliobolus)(无性型:平脐蠕孢属(Bipolaris)的长蠕孢属(Helminthosporium))物种(叶斑病);棉花(例如棉刺盘孢

[0262] (C.gossypii))、玉米(例如禾生刺盘孢(C.graminicola):炭疽病茎腐)、软果、马铃薯(例如球炭疽菌(C.coccodes):黑点病)、菜豆

[0263] (例如豆刺盘孢(C.lindemuthianum))、大豆(例如平头刺盘孢(C.truncatum)或盘长孢状刺盘孢(C.gloeosporioides))、蔬菜(例如葫芦刺盘孢(C.lagenarium)或辣椒刺盘

孢(C.capsici))、水果(例如尖孢炭疽菌(C.acutatum))、咖啡(例如咖啡刺盘孢(C.coffeanum)或卡哈瓦刺盘孢(C.kahawae))以及多种作物(胶孢炭疽菌(C.gloeosporioides))上的刺盘孢属(Colletotrichum)(有性型:小丛壳属(Glomerella))物种(炭疽病);伏革菌属(Corticium)物种,例如稻上的笹木伏革菌(C.sasakii)(纹枯病(sheath blight));大豆、棉花和观赏植物上的山扁豆生棒孢菌(Corynespora cassiicola)(叶斑病);孔雀斑病菌属(Cycloconium)物种,例如橄榄树上的油橄榄孔雀斑病菌(C.oleaginum);果树、藤本植物(例如鹅掌楸柱孢(C.liriodendri),有性型:鹅掌楸新丛赤壳(Neonectria liriodendri):黑脚病(Black Foot Disease))和观赏植物上的柱孢属(Cylindrocarpon)物种(例如果树溃疡病或幼藤衰败,有性型:丛赤壳属(Nectria)或新丛赤壳属(Neonectria)物种);大豆上的白纹羽束丝菌(Dematophora necatrix)(有性型:褐座坚壳菌(Rosellinia necatrix))(根茎腐病);间座壳属(Diaporthe)物种,例如大豆上的菜豆间座壳(D.phaseolorum)(猝倒);玉米、谷物例如大麦(例如大麦网斑内脐蠕孢(D.teres),网斑病(net blotch))和小麦(例如偃麦草内脐蠕孢(D.tritici-repentis):褐斑病(tan spot))、稻和坪草上的内脐蠕孢属(Drechslera)(同义词长蠕孢属(Helminthosporium),有性型:核腔菌属(Pyrenophora))物种;藤本植物上的Esca(梢枯病(dieback)、干枯病(apoplexy)),由层卧孔菌(Formitiporia punctata)(同义词斑孔木层孔菌(Phellinus punctata))、地中海层卧孔菌(F.mediterranea)、厚孢小褐球壳(Phaeomoniella chlamydospora)(之前称为Phaeoacremonium chlamydosporum)、褐枝顶孢霉(Phaeoacremonium aleophilum)和/或树花地衣葡萄座腔菌(Botryosphaeria obtusa)引起;梨果(梨痂囊腔菌(E.pyri))、软果(覆盆子痂囊腔菌(E.veneta):炭疽病)和藤本植物(痂囊腔菌(E.ampelina):炭疽病)上的痂囊腔菌属(Elsinoe)物种;稻上的稻叶黑粉菌(Entyloma oryzae)(叶黑粉病(leaf smut));小麦上的附球菌属(Epicoccum)物种(黑霉病(black mold));糖用甜菜(甜菜白粉菌(E.betae)),蔬菜(例如豌豆白粉菌(E.pisi))例如葫芦(例如二孢白粉菌(E.cichoracearum))、卷心菜、油菜(例如十字花科白粉菌(E.cruciferarum))上的白粉菌属(Erysiphe)物种(白粉病);果树、藤本植物和观赏木上的侧弯孢菌(Eutypa lata)(弯孢壳(Eutypa)溃疡病或梢枯病,无性型:Cytosporina lata,同义词Libertella blepharis);玉米(例如大斑凸脐蠕孢(E.turcicum))上的凸脐蠕孢属(Exserohilum)(同义词长蠕孢属(Helminthosporium))物种;多种植物上的镰孢菌属(Fusarium)(有性型:赤霉属(Gibberella))物种(萎蔫、根或茎腐病),如谷物(例如小麦或大麦)上的禾本科镰孢(F.graminearum)或黄色镰孢(F.culmorum)(根腐病、疮痂病(scab)或赤霉病(head blight))、番茄上的尖孢镰孢菌(F.oxysporum)、大豆上的腐皮镰孢(F.solani)(镰孢菌大豆专化型(f.sp.glycines),新的同义词大豆猝死综合症病原菌(F.virguliforme))和F.tucumaniae及F.brasiliense(均引起猝死综合征)和玉米上的轮枝镰孢(F.verticillioides);谷物(例如小麦或大麦)和玉米上的禾顶囊壳(Gaeumannomyces graminis)(全蚀病(take-all));谷物(例如玉蜀黍赤霉(G.zeae))和稻(例如藤仓赤霉(G.fujikuroi):恶苗病(Bakanae disease))上的赤霉属(Gibberella)物种;藤本植物、梨果和其他植物上的围小丛壳菌(Glomerella cingulata)和棉花上的棉小丛壳菌(G.gossypii);稻上的颗粒染色配合物(Grainstaining complex);藤本植物上的葡萄球座菌(Guignardia bidwellii)(黑腐病(black rot));蔷薇科植物和杜松上的胶锈菌

属(Gymnosporangium)物种,例如梨上的褐色胶锈菌(G.sabinae)(锈病);玉米、谷物、马铃薯和稻上的长蠕孢属(Helminthosporium)物种(同义词内脐蠕孢属(Drechslera),有性型:旋孢腔菌属(Cochliobolus));驼孢锈菌属(Hemileia)物种,例如咖啡上的咖啡驼孢锈菌(H.vastatrix)(咖啡叶锈病);藤本植物上的褐斑拟棒束孢(Isariopsis clavispora)(同义词Cladosporium vitis);大豆和棉花上的菜豆壳球孢(Macrophomina phaseolina)(同义词Macrophomina phaseoli)(根茎腐病);谷物(例如小麦或大麦)上的雪腐微座孢(Microdochium nivale)(同义词雪腐镰孢(Fusarium nivale))(粉雪霉病(pink snow mold));大豆上的扩散叉丝壳(Microsphaera diffusa)(白粉病);核果和其他蔷薇科植物上的链核盘菌属(Monilinia)物种,例如松散链核盘菌(M.laxa)、果生链核盘菌(M.fructicola)和果产链核盘菌(M.fructigena)(同义词从梗孢属(Monilia)物种:花腐病和枝枯病、褐腐病);谷物、香蕉、软果和落花生上的球腔菌属(Mycosphaerella)物种,如小麦上的禾生球腔菌(M.graminicola)(无性型:小麦发酵壳针孢(Zymoseptoria tritici),之前称为小麦壳针孢(Septoria tritici):壳针孢斑枯病),或香蕉上的斐济球腔菌(M.fijiensis)(同义词Pseudocercospora fijiensis:黑叶斑病(black Sigatoka disease))和香蕉生球腔菌(M.musicola),花生上的花生球腔菌(M.arachidicola)(同义词M.arachidis或Cercospora arachidis)、伯克利球腔菌(M.berkeleyi),豌豆上的M.pisi以及芸苔属上的芸苔生球腔菌(M.brassiciola);卷心菜(例如芸苔霜霉(P.brassicae))、油菜(例如寄生霜霉(P.parasitica))、洋葱(例如葱霜霉(P.destructor))、烟草(烟草霜霉(P.tabacina))和大豆(例如东北霜霉(P.manshurica))上的霜霉属(Peronospora)物种(霜霉病);大豆上的豆薯层锈菌(Phakopsora pachyrhizi)和山马蝗层锈菌(P.meibomiae)(大豆锈病);瓶霉属(Phialophora)物种,例如藤本植物(例如嗜管瓶霉(P.tracheiphila)和四孢藻瓶霉(P.tetraspora))和大豆(例如大豆瓶霉(P.gregata):茎腐病)上;油菜和卷心菜上的黑胫茎点霉(Phoma lingam)(同义词黑胫病菌(Leptosphaeria biglobosa)和十字花科小球腔菌(L.maculans):根茎腐病)和糖用甜菜上的甜菜茎点霉(P.betae)(根腐病、叶斑病和猝倒),以及玉米上的P.zeae-maydis(同义词Phyllostica zeae);向日葵、藤本植物(例如葡萄生拟茎点霉(P.viticola):蔓和叶斑病)和大豆(例如茎腐病:菜豆拟茎点霉(P.phaseoli),有性型:菜豆间座壳(Diaporthe phaseolorum))上的拟茎点霉(Phomopsis)物种;玉米上的玉蜀黍节壶菌(Physoderma maydis)(褐斑病);多种植物上的疫霉属(Phytophthora)物种(萎蔫,根、叶、果实和茎腐病),如红辣椒和葫芦(例如辣椒疫霉(P.capsici))、大豆(例如大雄疫霉(P.megasperma),同义词大豆疫霉(P.sojae))、马铃薯和番茄(例如致病疫霉(P.infestans):晚疫病)和阔叶树(例如橡树疫霉(P.ramorum):橡树猝死);卷心菜、油菜、萝卜和其他植物上的芸苔根肿菌(Plasmodiophora brassicae)(根肿病(club root));单轴霉属(Plasmopara)物种,例如藤本植物上的葡萄生单轴霉(P.viticola)(葡萄霜霉病)和向日葵上的霍尔斯单轴霉(P.halstedii);蔷薇科植物、蛇麻、梨果和软果上的叉丝单囊壳属(Podosphaera)物种(白粉病),例如苹果上的白叉丝单囊壳(P.leucotricha)和葫芦上的瓜类单囊壳(P.xanthii);例如谷物如大麦和小麦(禾谷多粘霉(P.graminis))和糖用甜菜(甜菜多粘霉(P.betae))上的多粘霉属(Polymyxa)物种,和由此传播的病毒病;谷物例如小麦或大麦上的小麦基腐病菌(Pseudocercosporella herpotrichoides)(同义词Oculimacula yallundae、O.acuformis:眼斑病,有性型:

Tapesia yallundae);多种植物上的假霜霉属(Pseudoperonospora)(霜霉病),例如葫芦上的古巴假霜霉(P.cubensis)或蛇麻上的葎草假霜霉(P.humili);藤本植物上的八孢假无柄盘菌(Pseudopezicula tracheiphila)(红火病(red fire disease)或rotbrenner,无性型:瓶霉属(Phialophora));多种植物上的柄锈菌属(Puccinia)物种(锈病),例如谷物如小麦、大麦或黑麦上的小麦柄锈菌(P.triticina)(褐锈病或叶锈病)、条形柄锈菌(P.striiformis)(条锈病或黄锈病)、大麦柄锈菌(P.hordei)(矮锈病)、禾柄锈菌(P.graminis)(秆锈病或黑锈病)或隐匿柄锈菌(P.recondita)(棕锈病或叶锈病),甘蔗上的屈恩柄锈菌(P.kuehnii)(柑橘锈病)和芦笋上的天门冬属柄锈菌(P.asparagi);埋核盘菌属(Pyrenopeziza)物种,例如油菜上的芸苔埋核盘菌(P.brassicae);小麦上的偃麦草核腔菌(Pyrenophora tritici-repentis)(无性型:偃麦草内脐蠕孢(Drechslera tritici-repentis))(褐斑病)或大麦上的圆核腔菌(P.teres)(网斑病);梨孢属(Pyricularia)物种,例如稻上的稻梨孢(P.oryzae)(有性型:稻瘟病菌(Magnaporthe grisea):稻瘟病),以及坪草和谷物上的灰梨孢(P.grisea);坪草、稻、玉米、小麦、棉花、油菜、向日葵、大豆、糖用甜菜、蔬菜和多种其他植物上的腐霉属(Pythium)物种(猝倒)(例如终极腐霉(P.ultimum)或瓜果腐霉(P.aphanidermatum))以及蘑菇上的寡雄腐霉(P.oligandrum);柱隔孢属(Ramularia)物种,例如大麦上的R.collo-cygni(柱隔孢叶斑病、生理叶斑病),棉花上的白斑柱隔孢(R.areola)(有性型:网孢球腔菌(Mycosphaerella areola))和糖用甜菜上的甜菜生柱隔孢(R.beticola);棉花、稻、马铃薯、坪草、玉米、油菜、马铃薯、糖用甜菜、蔬菜和多种其他植物上的丝核菌属(Rhizoctonia)物种,例如大豆上的立枯丝核菌(R.solani)(根茎腐病)、稻上的立枯丝核菌(R.solani)(纹枯病)或者小麦或大麦上的禾谷丝核菌(R.cerealis)(丝核菌春叶枯病);草莓、胡萝卜、卷心菜、藤本植物和番茄上的匍枝根霉(Rhizopus stolonifer)(黑霉病、软腐病);大麦、黑麦和黑小麦上的黑麦喙孢(Rhynchosporium secalis)和R.commune(灼枯病(scald));稻上的稻帚枝杆孢菌(Sarocladium oryzae)和S.attenuatum(鞘腐病);蔬菜(小核盘菌(S.minor)和核盘菌(S.sclerotiorum))和大田作物,例如油菜、向日葵(例如核盘菌)和大豆上的核盘菌属(Sclerotinia)物种(茎腐病或白霉),大豆、花生、蔬菜、玉米、谷物和观赏植物上的齐整小核菌(S.rolfsii)(同义词Athelia rolfsii);多种植物上的壳针孢属(Septoria)物种,例如大豆上的大豆壳针孢(S.glycines))(褐斑病)、小麦上的小麦壳针孢(S.tritici)(同义词小麦发酵壳针孢(Zymoseptoria tritici),壳针孢斑枯病)和谷物上的颖枯壳针孢(S.nodorum)(同义词颖枯壳多孢(Stagonospora nodorum)(壳多孢属斑枯病);藤本植物上的葡萄钩丝壳(Uncinula necator)(同义词葡萄白粉菌(Erysiphe necator))(白粉病,无性型:葡萄粉孢(Oidium tuckeri));玉米(例如玉米大斑病菌(S.turcicum),同义词大斑病长蠕孢(Helminthosporium turcicum))和坪草上的大斑病菌属(Setosphaeria)物种(叶枯病);玉米(例如,丝轴黑粉菌(S.reiliana),同义词Ustilago reiliana:丝黑穗病)、高粱和甘蔗上的轴黑粉菌属(Sphacelotheca)物种(黑穗病);葫芦上的单丝壳菌(Sphaerotheca fuliginea)(同义词瓜类单囊壳(Podosphaera xanthii):白粉病);马铃薯上的马铃薯粉痂菌(Spongospora subterranea)(粉痂病)和由此传播的病毒病;谷物上的壳多孢属(Stagonospora)物种,例如小麦上的颖枯壳多孢(S.nodorum)(壳多孢属斑枯病,有性型:颖枯小球腔菌(Leptosphaeria nodorum)[同义词颖枯暗球腔菌(Phaeosphaeria nodorum)],

同义词颖枯壳针孢(Septoria nodorum));马铃薯上的内生集壶菌(Synchytrium endobioticum)(马铃薯癌肿病);外囊菌属(Taphrina)物种,例如桃上的畸形外囊菌(T.deformans)(缩叶病)和李树上的李外囊菌(T.pruni)(李囊果病(plum pocket));烟草、梨果、蔬菜、大豆和棉花上的根串珠霉属(Thielaviopsis)物种(黑根腐病),例如根串珠霉(T.basicola)(同义词Chalara elegans);谷物上的腥黑粉菌属(Tilletia)物种(腥黑穗病(common bunt或stinking smut)),例如像小麦上的小麦腥黑粉菌(T.tritici)(同义词小麦网腥黑粉菌(T.caries),小麦腥黑穗病)和小麦矮腥黑粉菌(T.controversa)(矮腥黑穗病);蘑菇上的哈茨木霉(Trichoderma harzianum);大麦或小麦上的肉孢核瑚菌(Typhula incarnate)(灰雪腐霉病(grey snow mold));条黑粉菌属(Urocystis)物种,例如黑麦上的隐条黑粉菌(U.occulta)(秆黑穗病(stem smut));蔬菜例如菜豆(例如疣顶单胞锈菌(U.appendiculatus),同义词菜豆单胞锈菌(U.phaseoli))、糖用甜菜(例如甜菜单胞锈菌(U.betae)或甜菜生胞锈菌(U.beticola))和干豆(例如豇豆单胞锈菌(U.vignae)、U.pisi、野豌豆单胞锈菌(U.viciae-fabae)和蚕豆单胞锈菌(U.fabae))上的单胞锈菌属(Uromyces)物种(锈病);谷物(例如麦散黑粉菌(U.nuda)和燕麦散黑粉菌(U.avaenae))、玉米(例如玉蜀黍黑粉菌(U.maydis):玉米黑粉病)和甘蔗上的黑粉菌属(Ustilago)物种(散黑穗病(loose smut));苹果(例如苹果黑星菌(V.inaequalis))和梨上的黑星菌属(Venturia)物种(疮痂病(scab));以及多种植物例如水果和观赏植物、藤本植物、软果、蔬菜和大田作物上的轮枝孢属(Verticillium)物种(萎蔫),例如油菜上的长孢轮枝孢(V.longisporum),草莓、油菜、马铃薯和番茄上的大丽花轮枝孢(V.dahliae)以及蘑菇上的真菌轮枝孢(V.fungicola);谷物上的小麦发酵壳针孢。

[0264] 化合物I及其组合物分别特别适用于控制以下植物病害的致病病原:大豆和谷物上的锈病(例如大豆上的豆薯层锈菌和山马蝗层锈菌;小麦上的小麦叶锈菌(Puccinia tritici)和条纹锈菌(P.striiformis));特色作物、大豆、油菜和向日葵上的霉病(例如草莓和藤本植物上的灰葡萄孢菌,油菜、向日葵和大豆上的核盘菌、小核盘菌和齐整小核菌(S.rolfsii));谷物上的镰孢菌属病害(例如小麦上的黄色镰孢菌和禾谷镰孢菌);特色作物上的霜霉病(例如藤本植物上的葡萄霜霉病菌,马铃薯上的晚疫菌);特色作物和谷物上的白粉病(例如藤本植物上的葡萄钩丝壳,各种特色作物上的白粉菌属物种,谷物上的禾本科布氏白粉菌);以及谷物、大豆和玉米上的叶斑病(例如谷物上的小麦壳针孢和颖枯壳针孢,大豆上的大豆壳针孢,玉米和大豆上的尾孢属物种)。

[0265] 化合物I及其组合物还分别在储存产品或收获物的保护以及材料的保护中适合用于控制有害微生物。

[0266] 术语“储存产品或收获物”应理解为表示植物或动物来源的天然物质以及长期保护所需的其加工形式。植物来源的储存产品,例如茎秆、叶子、块茎、种子、果实或谷粒可以以新鲜收割的状态或者以预干燥的、弄湿的、粉碎的、磨碎的、压榨的或烘烤的等加工形式(该加工也被称为收割后处理)进行保护。同样落在储存产品定义下的是木材,无论为原木形式,如建筑木材、输电塔和栅栏,或为制成品形式,如由木头制造的家具或物体。动物来源的储存产品是兽皮、皮革、毛皮、毛发等。优选地,“储存产品”应理解为表示植物来源的天然物质及其加工形式,更优选果实及其加工形式,如梨果、核果、软果和柑橘类水果及其加工形式,其中化合物I及其组合物的施用还可以防止腐烂、变色或发霉等不利影响。

[0267] 术语“材料的保护”应理解为表示保护技术和非生命材料如粘合剂、胶、木料、纸、纸板、纺织品、皮革、油漆分散体、塑料、冷却润滑剂、纤维、或织物以防有害微生物(如真菌和细菌)侵染和破坏。

[0268] 当用于材料或储存产品的保护中时,所施用的活性物质的量取决于应用领域的种类和期望的效果。通常施用于材料的保护中的量是0.001g至2kg、优选0.005g至1kg活性物质/立方米经处理的材料。

[0269] 化合物I及其组合物可以分别用于改善植物的健康。本发明还涉及一种用于通过以下方式改善植物健康的方法:分别用有效量的化合物I及其组合物处理植物、其繁殖材料和/或植物正在生长或将要生长的场所。

[0270] 术语“植物健康”应理解为表示植物和/或其产品的状况,其通过单独或彼此组合的多项指标确定,如产量(例如增加的生物质和/或增加的有价值成分的含量)、植物活力(例如改善的植物生长和/或更绿的叶子(“绿化效果”))、品质(例如改善的某些成分的含量或组成)、以及对非生物和/或生物胁迫的耐受性。以上确定的植物健康状况指标可以相互依存或者可以相互影响。

[0271] 化合物I按原样或以组合物的形式使用,通过用杀真菌有效量的活性物质处理真菌,植物,植物繁殖材料(如种子),待保护免受真菌侵袭的土壤、表面、材料或房间。施用可以在植物、植物繁殖材料(如种子)、土壤、表面、材料或房间受真菌感染之前和之后进行。

[0272] 农用化学组合物包含杀真菌有效量的化合物I。术语“杀真菌有效量”表示足以用于控制栽培植物上、或储存产品或收获物的保护、或材料的保护中的有害真菌,并且不会对经处理的植物、经处理的储存产品或收获物、或对经处理的材料产生实质损害的组合物或化合物I的量。此种量可以在广泛的范围内变化并且取决于各种因素,诸如待控制的真菌物种,经处理的栽培植物、储存产品、收获物或材料,气候条件和所使用的具体化合物I。

[0273] 植物繁殖材料可以在种植或移植时或在种植或移植之前用化合物I本身或包含至少一种化合物I的组合物预防性地处理。

[0274] 当用于植物保护中时,取决于期望的效果类型,所施用的活性物质的量是0.001至2kg/ha、优选0.005至2kg/ha、更优选0.05至0.9kg/ha、并且特别是0.1至0.75kg/ha。

[0275] 在植物繁殖材料(如种子)的处理中,例如通过撒粉、涂覆或浸透,每100kg的植物繁殖材料(优选种子)需要通常0.1至1000g、优选1至1000g、更优选1至100g、并且最优选5至100g的活性物质的量。

[0276] 使用者通常由预先给药装置、背负式喷雾器、喷雾罐、喷雾飞机、或灌溉系统施用农用化学组合物。通常,农用化学组合物用水、缓冲液、和/或另外的辅助剂制成至期望的施用浓度,并且因此获得根据本发明的即用型喷雾液或农用化学组合物。通常,每公顷农业可用面积施用20至2000升、优选地50至400升的即用型喷雾液。

[0277] 化合物I、其N-氧化物和盐可以转化成常用类型的农用化学组合物,例如溶液、乳液、悬浮液、粉尘剂、粉剂、糊剂、颗粒剂、压片剂、胶囊、及其混合物。组合物类型的实例(还参见“Catalogue of pesticide formulation types and international coding system [杀有害生物剂配制品类型和国际编码系统目录]”,Technical Monograph[技术专论]第2期,第6版,2008年5月,CropLife International[国际作物生命协会])是悬浮液(例如SC、OD、FS)、可乳化浓缩液(例如EC)、乳液(例如EW、EO、ES、ME)、胶囊(例如CS、ZC)、糊剂、锭剂、

可湿性粉末或粉剂(例如WP、SP、WS、DP、DS)、压制剂(例如BR、TB、DT)、颗粒剂(例如WG、SG、GR、FG、GG、MG)、杀昆虫制品(例如LN)以及用于处理植物繁殖材料(如种子)的凝胶配制品(例如GF)。这些组合物以已知的方式制备,诸如由以下所描述的:Mollet和Grubemann,Formulation technology[配制品技术],Wiley VCH,Weinheim,2001;或Knowles,New developments in crop protection product formulation[作物保护产品配制的新发展],Agrow Reports[世界农作物保护新闻报告]DS243,T&F Informa[泰勒-弗朗西斯英富曼公司],London[伦敦],2005。本发明还涉及包含助剂和至少一种化合物I的农用化学组合物。

[0278] 合适的助剂是溶剂、液体载体、固体载体或填料、表面活性剂、分散剂、乳化剂、湿润剂、辅助剂、增溶剂、渗透增强剂、保护性胶体、粘着剂、增稠剂、保湿剂、忌避剂、引诱剂、取食刺激剂、相容剂、杀菌剂、防冻剂、防沫剂、着色剂、增粘剂和粘合剂。

[0279] 合适的溶剂和液体载体是水和有机溶剂,例如中至高沸点的矿物油级分,如煤油、柴油;植物或动物来源的油;脂肪族烃、环烃和芳香族烃,例如甲苯、石蜡、四氢化萘和烷基化萘;醇,例如乙醇、丙醇、丁醇、苯甲醇、环己醇、乙二醇;DMSO;酮,例如环己酮;酯,例如乳酸盐、碳酸盐、脂肪酸酯、γ-丁内酯;脂肪酸;膦酸酯;胺;酰胺,例如N-甲基吡咯烷酮,脂肪酸二甲基酰胺;及其混合物。

[0280] 合适的固体载体或填料是矿物土,例如硅酸盐、硅胶、滑石粉、高岭土、石灰石、石灰、白垩、粘土、白云石、硅藻土、膨润土、硫酸钙、硫酸镁、氧化镁;多糖,例如纤维素、淀粉;肥料,例如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、尿素;植物来源的产品,例如谷物粉、树皮粉、木粉、坚果壳粉及其混合物。

[0281] 合适的表面活性剂是表面活性化合物,诸如阴离子、阳离子、非离子和两性表面活性剂,嵌段聚合物,聚电解质,以及其混合物。此类表面活性剂可以被用作乳化剂、分散剂、增溶剂、润湿剂、渗透增强剂、保护胶体、或辅助剂。表面活性剂的实例列于McCutcheon's,第1卷:Emulsifiers&Detergents[乳化剂和洗涤剂],McCutcheon's Directories,Glen Rock,USA,2008(国际版或北美洲版)中。

[0282] 合适的阴离子表面活性剂是磺酸盐、硫酸盐、磷酸盐、羧酸盐的碱金属盐、碱土金属盐或铵盐及其混合物。磺酸盐的实例是烷基芳基磺酸盐、二苯基磺酸盐、α-烯烃磺酸盐、木质素磺酸盐、脂肪酸和油的磺酸盐、乙氧基化烷基酚的磺酸盐、烷氧基化芳基酚的磺酸盐、缩合萘的磺酸盐、十二烷基苯和十三烷基苯的磺酸盐、萘和烷基萘的磺酸盐、磺基琥珀酸盐或琥珀酰胺磺酸盐(sulfosuccinamate)。硫酸盐的实例是脂肪酸、油、乙氧基化烷基酚、醇、乙氧基化醇或脂肪酸酯的硫酸盐。磷酸盐的实例是磷酸盐酯。羧酸盐的实例是烷基羧酸盐以及羧化醇或烷基酚乙氧基化物。

[0283] 合适的非离子表面活性剂是烷氧基化物、N-取代的脂肪酸酰胺、胺氧化物、酯、糖基表面活性剂、聚合物表面活性剂及其混合物。烷氧基化物的实例是化合物如已经被1至50当量烷氧基化的醇、烷基酚、胺、酰胺、芳基酚、脂肪酸或脂肪酸酯。环氧乙烷和/或环氧丙烷可以用于烷氧基化,优选环氧乙烷。N-取代的脂肪酸酰胺的实例是脂肪酸葡糖酰胺或脂肪酸链烷醇酰胺。酯的实例是脂肪酸酯、甘油酯或甘油单酯。糖基表面活性剂的实例是山梨聚糖、乙氧基化山梨聚糖、蔗糖和葡萄糖酯或烷基聚葡萄糖苷。聚合物表面活性剂的实例是乙烯基吡咯烷酮、乙烯醇或乙酸乙烯酯的同源物或共聚物。

[0284] 合适的阳离子表面活性剂是季铵表面活性剂,例如具有一个或两个疏水基团的季铵化合物、或长链伯胺的盐。合适的两性表面活性剂是烷基甜菜碱和咪唑啉。合适的嵌段聚合物是包含聚氧化乙烯和聚环氧丙烷嵌段的A-B或A-B-A型嵌段聚合物,或包含烷醇、聚氧化乙烯和聚环氧丙烷的A-B-C型嵌段聚合物。合适的聚电解质是多酸或多碱。多酸的实例是聚丙烯酸或多酸梳状聚合物的碱金属盐。多元碱的实例是聚乙烯基胺或聚乙烯胺。

[0285] 合适的辅助剂是化合物,这些化合物本身具有可忽略不计的杀有害生物活性甚至没有杀有害生物活性,并且可提高化合物I对靶标的生物学性能。实例是表面活性剂、矿物油或植物油以及其他辅助剂。另外的实例由Knowles,Adjuvants and additives[辅助剂和添加剂],Agrow Reports DS256,T&F Informa UK,2006,第5章列出。

[0286] 合适的增稠剂是多糖(例如黄原胶、羧甲基纤维素)、无机粘土(有机改性的或未改性的)、聚羧酸盐和硅酸盐。

[0287] 合适的杀菌剂是溴硝醇(bronopol)和异噻唑啉酮衍生物,如烷基异噻唑啉酮和苯并异噻唑啉酮。

[0288] 合适的防冻剂是乙二醇、丙二醇、脲和甘油。

[0289] 合适的消泡剂是硅酮、长链醇和脂肪酸的盐。

[0290] 合适的着色剂(例如红色、蓝色或绿色)是低水溶性颜料和水溶性染料。实例是无机着色剂(如氧化铁、氧化钛、六氰合铁酸铁(iron hexacyanoferrate))和有机着色剂(如茜素、偶氮和酞菁着色剂)。

[0291] 合适的增粘剂或粘合剂是聚乙烯吡咯烷酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇、聚丙烯酸酯、生物蜡或合成蜡以及纤维素醚。

[0292] 农用化学组合物通常包含按重量计0.01%至95%、优选0.1%至90%、更优选1%至70%,并且特别是10%至60%的活性物质(例如至少一种化合物I)。农用化学组合物通常包含按重量计5%至99.9%、优选10%至99.9%、更优选30%至99%,并且特别是40%至90%的至少一种助剂。活性物质(例如化合物I)以90%至100%、优选95%至100%的纯度(根据NMR谱图)采用。

[0293] 出于处理植物繁殖材料特别是种子的目的,通常使用种子处理用溶液(LS)、悬浮乳液(SE)、可流动浓缩液(FS)、干法处理用粉末(DS)、浆料处理用水分散性粉末(WS)、水溶性粉末(SS)、乳液(ES)、可乳化浓缩液(EC)和凝胶(GF)。在2至10倍稀释后,所讨论的组合物的即用制剂中活性物质浓度为按重量计0.01%至60%,优选地0.1%至40%。施用可以在播种之前或期间进行。用于分别将化合物I及其组合物施用于植物繁殖材料、尤其是种子的方法包括拌制、涂覆、造粒、撒粉、浸泡以及沟内施用方法。优选地,将化合物I或其组合物通过使得不诱发萌发的方法,例如通过拌种、造粒、涂覆和撒粉分别施用到植物繁殖材料上。

[0294] 各种类型的油、湿润剂、辅助剂、肥料或微量营养物质以及另外的杀有害生物剂(例如杀真菌剂、生长调节剂、除草剂、杀昆虫剂、安全剂)可以作为预混料添加到化合物I或其组合物中,或者直到使用前才加入(罐式混合(tank mix))。这些试剂可以以1:100至100:1、优选地1:10至10:1的重量比与根据本发明的组合物掺合。

[0295] 杀有害生物剂通常是通过其效果将有害生物阻止、失能、杀灭或在其他方面受挫的化学或生物药剂(如杀有害生物活性成分、化合物、组合物、病毒、细菌、抗微生物剂或消毒剂)。目标有害生物可以包括破坏财产、引起妨害、传播疾病或为疾病的媒介的昆虫、植物

病原体、杂草、软体动物、鸟、哺乳动物、鱼、线虫(蛔虫)和微生物。术语“杀有害生物剂”还包括改变植物的预期生长、开花或繁殖率的植物生长调节剂;引起叶子或其他枝叶从植物脱落的落叶剂,通常促进收获;促进活体组织,如不想要的植物地上部分的干燥的干燥剂;活化植物生理机能以防御某些有害生物的植物活化剂;降低杀有害生物剂对作物植物的不想要的除草作用的安全剂;以及影响植物生理机能例如以增强植物生长、生物质、产量或作物植物的可收获物品的任何其他质量参数的植物生长促进剂。

[0296] 生物杀有害生物剂被定义为基于微生物(细菌、真菌、病毒、线虫等)的杀有害生物剂或天然产品(化合物,如代谢物、蛋白质或来自生物或其他天然来源的提取物)的形式(美国环境保护署(U.S.Environmental Protection Agency):http://www.epa.gov/pesticides/biopesticides/)。生物杀有害生物剂落入两个主要类别,微生物和生物化学杀有害生物剂:

[0297] (1)微生物杀有害生物剂由细菌、真菌或病毒组成(并且通常包括细菌和真菌产生的代谢物)。昆虫病原线虫也被归类为微生物杀有害生物剂,尽管它们是多细胞的。

[0298] (2)生物化学杀有害生物剂是防治有害生物或提供如下文所定义的其他作物保护用途,但对哺乳动物相对无毒的天然存在的物质。

[0299] 将作为杀真菌剂的使用形式的化合物I或包含它们的组合物与其他杀真菌剂混合在许多情况下致使杀真菌活性谱的扩展或防止杀真菌剂抗性的发展。此外,在许多情况下,获得了协同效果(协同混合物)。

[0300] 可以与化合物I结合使用的以下杀有害生物剂II清单旨在说明可能的组合,但不限制它们:

[0301] A)呼吸抑制剂

[0302] -在Q_o位点的配合物III抑制剂:嘧菌酯(A.1.1)、甲香菌酯(A.1.2)、丁香菌酯(A.1.3)、醚菌胺(A.1.4)、烯肟菌酯(A.1.5)、烯肟菌胺(A.1.6)、氟菌螨酯(fenoxystrobin/flufenoxystrobin)(A.1.7)、氟嘧菌酯(A.1.8)、醚菌酯(A.1.9)、甲苯醚菌酯(mandestrobin)(A.1.10)、苯氧菌胺(A.1.11)、肟醚菌胺(A.1.12)、啶氧菌酯(A.1.13)、唑菌胺酯(A.1.14)、唑胺菌酯(A.1.15)、唑菌酯(A.1.16)、肟菌酯(A.1.17)、2-(2-(3-(2,6-二氯苯基)-1-甲基-亚烯丙基氨基氧基甲基)-苯基)-2-甲氧亚氨基-N-甲基-乙酰胺(A.1.18)、吡菌苯威(A.1.19)、氯啶菌酯(triclopyricarb/chlorodincarb)(A.1.20)、噁唑酮菌(A.1.21)、咪唑菌酮(A.1.21)、甲基-N-[2-[(1,4-二甲基-5-苯基-吡唑-3-基)氧基甲基]苯基]-N-甲氧基-氨基甲酸酯(A.1.22)、四唑菌酮(A.1.25)、(Z,2E)-5-[1-(2,4-二氯苯基)吡唑-3-基]氧基-2-甲氧亚氨基-N,3-二甲基-戊-3-烯酰胺(A.1.34)、(Z,2E)-5-[1-(4-氯苯基)吡唑-3-基]氧基-2-甲氧亚氨基-N,3-二甲基-戊-3-烯酰胺(A.1.35)、嘧螨胺(A.1.36)、吡氟菌酯(A.1.37)、2-(邻-((2,5-二甲基苯基-氧基亚甲基)苯基)-3-甲氧基-丙烯酸甲酯(A.1.38);

[0303] -在Q_i位点的配合物III抑制剂:氰霜唑(A.2.1)、吲唑磺菌胺(A.2.2)、2-甲基丙酸[(6S,7R,8R)-8-苄基-3-[(3-羟基-4-甲氧基-吡啶-2-羰基)氨基]-6-甲基-4,9-二氧代-1,5-二氧壬环-7-基]酯(A.2.3)、吡啶菌胺(fenpicoxamid)(A.2.4)、吡啶菌酰胺(A.2.5)、吡啶草酰胺(metarylpicoxamid)(A.2.6);

[0304] -配合物II抑制剂:麦锈灵(A.3.1)、苯并烯氟菌唑(A.3.2)、联苯吡菌胺(A.3.3)、

啶酰菌胺(A.3.4)、萎锈灵(A.3.5)、甲呋酰胺(A.3.6)、氟吡菌酰胺(A.3.7)、氟酰胺(A.3.8)、氟唑菌酰胺(A.3.9)、呋吡菌胺(A.3.10)、异丙噻菌胺(A.3.11)、吡唑萘菌胺(A.3.12)、灭锈胺(A.3.13)、氧化萎锈灵(A.3.14)、氟唑菌苯胺(A.3.15)、吡噻菌胺(A.3.16)、氟唑菌酰羟胺(A.3.17)、联苯吡嗪菌胺(A.3.18)、氟唑环菌胺(A.3.19)、叶枯酞(A.3.20)、噻呋酰胺(A.3.21)、茚吡菌胺(inpyrfluxam)(A.3.22)、吡炔虫酰胺(pyrapropoyne)(A.3.23)、氟茚唑菌胺(A.3.28)、N-[2-[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]苯基]-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-吡唑-4-甲酰胺(A.3.29)、(E)-2-[2-[(5-氰基-2-甲基-苯氧基)甲基]苯基]-3-甲氧基-丙-2-烯酸甲酯(A.3.30)、异丙氟吡菌胺(isoflucypram)(A.3.31)、2-(二氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-茚满-4-基)吡啶-3-甲酰胺(A.3.32)、2-(二氟甲基)-N-[(3R)-1,1,3-三甲基茚满-4-基]吡啶-3-甲酰胺(A.3.33)、2-(二氟甲基)-N-(3-乙基-1,1-二甲基-茚满-4-基)吡啶-3-甲酰胺(A.3.34)、2-(二氟甲基)-N-[(3R)-3-乙基-1,1-二甲基-茚满-4-基]吡啶-3-甲酰胺(A.3.35)、2-(二氟甲基)-N-(1,1-二甲基-3-丙基-茚满-4-基)吡啶-3-甲酰胺(A.3.36)、2-(二氟甲基)-N-[(3R)-1,1-二甲基-3-丙基-茚满-4-基]吡啶-3-甲酰胺(A.3.37)、2-(二氟甲基)-N-(3-异丁基-1,1-二甲基-茚满-4-基)吡啶-3-甲酰胺(A.3.38)、2-(二氟甲基)-N-[(3R)-3-异丁基-1,1-二甲基-茚满-4-基]吡啶-3-甲酰胺(A.3.39)、三氟吡啶胺(A.3.24)；

[0305] -其他呼吸抑制剂:二氟林(A.4.1)；硝基苯基衍生物:乐杀螨(A.4.2)、敌螨通(A.4.3)、敌螨普(A.4.4)、氟啶胺(A.4.5)、消螨多(A.4.6)、嘧菌腙(A.4.7)；有机金属化合物:三苯锡盐,例如三苯基乙酸锡(A.4.8)、三苯基氯化锡(A.4.9)或三苯基氢氧化锡(A.4.10)；唑嘧菌胺(A.4.11)；硅噻菌胺(A.4.12)；

[0306] B)甾醇生物合成抑制剂(SBI杀真菌剂)

[0307] -C14脱甲基酶抑制剂:三唑:戊环唑(B.1.1)、联苯三唑醇(B.1.2)、糠菌唑(B.1.3)、环唑醇(B.1.4)、噁醚唑(B.1.5)、烯唑醇(B.1.6)、烯唑醇-M(B.1.7)、氟环唑(B.1.8)、腈苯唑(B.1.9)、氟喹唑(B.1.10)、氟硅唑(B.1.11)、粉唑醇(B.1.12)、己唑醇(B.1.13)、酰胺唑(B.1.14)、种菌唑(B.1.15)、叶菌唑(B.1.17)、腈菌唑(B.1.18)、噁咪唑(B.1.19)、多效唑(B.1.20)、戊菌唑(B.1.21)、丙环唑(B.1.22)、丙硫菌唑(B.1.23)、硅氟唑(B.1.24)、戊唑醇(B.1.25)、氟醚唑(B.1.26)、三唑酮(B.1.27)、唑菌醇(B.1.28)、灭菌唑(B.1.29)、烯效唑(B.1.30)、2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-3-(四唑-1-基)-1-[5-[4-(2,2,2-三氟乙氧基)苯基]-2-吡啶基]丙-2-醇(B.1.31)、2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-3-(四唑-1-基)-1-[5-[4-(三氟甲氧基)苯基]-2-吡啶基]丙-2-醇(B.1.32)、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羟基-3-(5-硫烷基-1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲腈(B.1.33)、伊芬三氟康唑(ipfentrifluconazole)(B.1.37)、氯氟醚菌唑(B.1.38)、(2R)-2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(2S)-2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、2-(氯甲基)-2-甲基-5-(对甲苯基甲基)-1-(1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇(B.1.43)；咪唑:抑霉唑(B.1.44)、稻瘟酯(B.1.45)、咪鲜胺(B.1.46)、氟菌唑(B.1.47)；嘧啶、吡啶、哌嗪:氯苯嘧啶醇(B.1.49)、啶斑肟(B.1.50)、嗪氨灵(B.1.51)、[3-(4-氯-2-氟-苯基)-5-(2,4-二氟苯基)异噁唑-4-基]-(3-吡啶基)甲醇(B.1.52)、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羟基-3-(1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲腈(B.1.53)、2-[6-(4-溴苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶

基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇(B.1.54)、2-[6-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇(B.1.55)；

[0308] -δ14-还原酶抑制剂:4-十二烷基-2,6-二甲基吗啉(aldimorph)(B.2.1)、吗菌灵(B.2.2)、吗菌灵乙酸酯(B.2.3)、丁苯吗啉(B.2.4)、克啉菌(B.2.5)、苯锈啶(B.2.6)、粉病灵(B.2.7)、螺环菌胺(B.2.8)；

[0309] -3-酮基还原酶抑制剂:环酰菌胺(B.3.1)；

[0310] -其他甾醇生物合成抑制剂:氯苯肟唑(B.4.1)；

[0311] C)核酸合成抑制剂

[0312] -苯基酰胺类或酰基氨基酸杀真菌剂:苯霜灵(C.1.1)、精苯霜灵(benalaxyl-M)(C.1.2)、精苯霜灵(kiralaxyl)(C.1.3)、甲霜灵(C.1.4)、精甲霜灵(C.1.5)、呋酰胺(C.1.6)、噁霜灵(C.1.7)；

[0313] -其他核酸合成抑制剂:噁霉灵(C.2.1)、辛噻酮(C.2.2)、噁喹酸(C.2.3)、乙嘧酚磺酸酯(C.2.4)、5-氟胞嘧啶(C.2.5)、5-氟-2-(对甲苯基甲氧基)嘧啶-4-胺(C.2.6)、5-氟-2-(4-氟苯基甲氧基)嘧啶-4-胺(C.2.7)、5-氟-2-(4-氯苯基甲氧基)嘧啶-4-胺(C.2.8)；

[0314] D)细胞分裂和细胞骨架抑制剂

[0315] -微管蛋白抑制剂:苯菌灵(D.1.1)、多菌灵(D.1.2)、麦穗宁(D1.3)、涕必灵(D.1.4)、甲基托布津(D.1.5)、氟苯菌哒嗪(pyridachlometyl)(D.1.6)、N-乙基-2-[(3-乙炔基-8-甲基-6-喹啉基)氧基]丁酰胺(D.1.8)、N-乙基-2-[(3-乙炔基-8-甲基-6-喹啉基)氧基]-2-甲基硫烷基-乙酰胺(D.1.9)、2-[(3-乙炔基-8-甲基-6-喹啉基)氧基]-N-(2-氟乙基)丁酰胺(D.1.10)、2-[(3-乙炔基-8-甲基-6-喹啉基)氧基]-N-(2-氟乙基)-2-甲氧基-乙酰胺(D.1.11)、2-[(3-乙炔基-8-甲基-6-喹啉基)氧基]-N-丙基-丁酰胺(D.1.12)、2-[(3-乙炔基-8-甲基-6-喹啉基)氧基]-2-甲氧基-N-丙基-乙酰胺(D.1.13)、2-[(3-乙炔基-8-甲基-6-喹啉基)氧基]-2-甲基硫烷基-N-丙基-乙酰胺(D.1.14)、2-[(3-乙炔基-8-甲基-6-喹啉基)氧基]-N-(2-氟乙基)-2-甲基硫烷基-乙酰胺(D.1.15)、4-(2-溴-4-氟-苯基)-N-(2-氯-6-氟-苯基)-2,5-二甲基-吡唑-3-胺(D.1.16)；

[0316] -其他细胞分裂抑制剂:乙霉威(D.2.1)、噻唑菌胺(D.2.2)、戊菌隆(D.2.3)、氟吡菌胺(D.2.4)、苯酰菌胺(D.2.5)、苯菌酮(D.2.6)、苯啶菌酮(pyriofenone)(D.2.7)、氰烯菌酯(D.2.8)；

[0317] E)氨基酸和蛋白质合成抑制剂

[0318] -蛋氨酸合成抑制剂:嘧菌环胺(E.1.1)、嘧菌胺(E.1.2)、嘧霉胺(E.1.3)；

[0319] -蛋白质合成抑制剂:杀稻瘟菌素-S(E.2.1)、春雷霉素(E.2.2)、春雷霉素盐酸盐水合物(E.2.3)、米多霉素(E.2.4)、链霉素(E.2.5)、土霉素(E.2.6)；

[0320] F)信号转导抑制剂

[0321] -MAP/组氨酸激酶抑制剂:氟氯菌核利(fluoroimid)(F.1.1)、异菌脲(F.1.2)、腐霉利(F.1.3)、乙烯菌核利(F.1.4)、咯菌腈(F.1.5)；

[0322] -G蛋白抑制剂:喹氧灵(F.2.1)；

[0323] G)脂质和膜合成抑制剂

[0324] -磷脂生物合成抑制剂:克瘟散(G.1.1)、异稻瘟净(G.1.2)、定菌磷(G.1.3)、稻瘟灵(G.1.4)；

[0325] -脂质过氧化:氯硝胺(G.2.1)、五氯硝基苯(G.2.2)、四氯硝基苯(G.2.3)、甲基立枯磷(G.2.4)、联苯(G.2.5)、地茂散(G.2.6)、氯唑灵(G.2.7)、噻唑锌(G.2.8);

[0326] -磷脂生物合成和细胞壁沉积:烯酰吗啉(G.3.1)、氟吗啉(G.3.2)、双炔酰菌胺(G.3.3)、丁吡吗啉(G.3.4)、苯噻菌胺(G.3.5)、异丙菌胺(G.3.6)、缬菌胺(G.3.7);

[0327] -影响细胞膜渗透性的化合物和脂肪酸:霜霉威(G.4.1);

[0328] -氧化甾醇结合蛋白抑制剂:氟噻唑吡乙酮(G.5.1)、氟沙普罗林(fluoxapiprolin)(G.5.3)、4-[1-[2-[3-二氟甲基-5-甲基-吡唑-1-基]乙酰基]-4-哌啶基]-N-四氢萘-1-基-吡啶-2-甲酰胺(G.5.4)、4-[1-[2-[3,5-双(二氟甲基)吡唑-1-基]乙酰基]-4-哌啶基]-N-四氢萘-1-基-吡啶-2-甲酰胺(G.5.5)、4-[1-[2-[3-(二氟甲基)-5-(三氟甲基)吡唑-1-基]乙酰基]-4-哌啶基]-N-四氢萘-1-基-吡啶-2-甲酰胺(G.5.6)、4-[1-[2-[5-环丙基-3-(二氟甲基)吡唑-1-基]乙酰基]-4-哌啶基]-N-四氢萘-1-基-吡啶-2-甲酰胺(G.5.7)、4-[1-[2-[5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基]乙酰基]-4-哌啶基]-N-四氢萘-1-基-吡啶-2-甲酰胺(G.5.8)、4-[1-[2-[5-(二氟甲基)-3-(三氟甲基)吡唑-1-基]乙酰基]-4-哌啶基]-N-四氢萘-1-基-吡啶-2-甲酰胺(G.5.9)、4-[1-[2-[3,5-双(三氟甲基)吡唑-1-基]乙酰基]-4-哌啶基]-N-四氢萘-1-基-吡啶-2-甲酰胺(G.5.10)、(4-[1-[2-[5-环丙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基]乙酰基]-4-哌啶基]-N-四氢萘-1-基-吡啶-2-甲酰胺(G.5.11);

[0329] H)具有多位点作用的抑制剂

[0330] -无机活性物质:波尔多混合剂(H.1.1)、铜(H.1.2)、乙酸铜(H.1.3)、氢氧化铜(H.1.4)、氯氧化铜(H.1.5)、碱式硫酸铜(H.1.6)、硫(H.1.7);

[0331] -硫代-和二硫代氨基甲酸酯:福美铁(H.2.1)、代森锰锌(H.2.2)、代森锰(H.2.3)、威百亩(H.2.4)、代森联(H.2.5)、甲基代森锌(H.2.6)、福美双(H.2.7)、代森锌(H.2.8)、福美锌(H.2.9);

[0332] -有机氯化合物:敌菌灵(H.3.1)、百菌清(H.3.2)、敌菌丹(H.3.3)、克菌丹(H.3.4)、灭菌丹(H.3.5)、抑菌灵(H.3.6)、双氯酚(H.3.7)、六氯苯(H.3.8)、五氯酚(H.3.9)及其盐、四氯苯酞(H.3.10)、对甲抑菌灵(H.3.11);

[0333] -胍及其他:胍(H.4.1)、多果定(H.4.2)、多果定游离碱(H.4.3)、双胍辛盐(guazatine)(H.4.4)、双胍辛乙酸盐(guazatine-acetate)(H.4.5)、双胍辛胺(H.4.6)、双胍辛胺三乙酸盐(H.4.7)、双胍三辛烷基苯磺酸盐(H.4.8)、二噻农(H.4.9)、2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二噻英并[2,3-c:5,6-c']二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮(H.4.10);

[0334] I)细胞壁合成抑制剂

[0335] -葡聚糖合成抑制剂:有效霉素(I.1.1)、多抗霉素B(I.1.2);

[0336] -黑色素合成抑制剂:咯喹酮(I.2.1)、三环唑(I.2.2)、环丙酰菌胺(I.2.3)、双氯氰菌胺(dicyclomet)(I.2.4)、稻瘟酰胺(I.2.5);

[0337] J)植物防御诱导剂

[0338] -阿拉酸式苯-S-甲基(J.1.1)、噻菌灵(J.1.2)、异噻菌胺(J.1.3)、噻酰菌胺(J.1.4)、调环酸-钙(J.1.5);膦酸酯:乙膦酸(J.1.6)、乙膦铝(J.1.7)、亚磷酸及其盐(J.1.8)、膦酸钙(J.1.11)、膦酸钾(J.1.12)、碳酸氢钾或钠(J.1.9)、4-环丙基-N-(2,4-二甲氧基苯基)噻二唑-5-甲酰胺(J.1.10);

[0339] K)未知作用模式

[0340] -溴硝醇(K.1.1)、灭螨蜢(K.1.2)、环氟菌胺(K.1.3)、霜脲氰(K.1.4)、棉隆(K.1.5)、咪菌威(K.1.6)、双氯氰菌胺(K.1.7)、哒菌清(K.1.8)、野燕枯(K.1.9)、野燕枯-甲基硫酸盐(K.1.10)、二苯胺(K.1.11)、种衣酯(K.1.12)、胺苯吡菌酮(K.1.13)、氟联苯菌(flumetover)(K.1.14)、磺菌胺(K.1.15)、氟噻唑菌腈(K.1.16)、超敏蛋白(K.1.17)、磺菌威(K.1.18)、三氯甲基吡啶(K.1.19)、酞菌酯(K.1.20)、三氟甲氧威(tolprocarb)(K.1.21)、喹啉铜(K.1.22)、丙氧喹啉(K.1.23)、异丁乙氧喹啉(tebufloquin)(K.1.24)、叶枯酞(K.1.25)、唑菌嗪(K.1.26)、N'-(4-(4-氯-3-三氟甲基-苯氧基)-2,5-二甲基-苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒(K.1.27)、N'-(4-(4-氟-3-三氟甲基-苯氧基)-2,5-二甲基-苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒(K.1.28)、N'-[4-[[3-[(4-氯苯基)甲基]-1,2,4-噻二唑-5-基]氧基]-2,5-二甲基-苯基]-N-乙基-N-甲基-甲脒(K.1.29)、N'-(5-溴-6-茚满-2-基氧基-2-甲基-3-吡啶基)-N-乙基-N-甲基-甲脒(K.1.30)、N'-[5-溴-6-[1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒(K.1.31)、N'-[5-溴-6-(4-异丙基环己氧基)-2-甲基-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒(K.1.32)、N'-[5-溴-2-甲基-6-(1-苯基乙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒(K.1.33)、N'-(2-甲基-5-三氟甲基-4-(3-三甲基硅烷基-丙氧基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒(K.1.34)、N'-(5-二氟甲基-2-甲基-4-(3-三甲基硅烷基-丙氧基)-苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒(K.1.35)、2-(4-氯-苯基)-N-[4-(3,4-二甲氧基-苯基)异噁唑-5-基]-2-丙-2-炔氧基-乙酰胺(K.1.36)、3-[5-(4-氯-苯基)-2,3-二甲基-异噁唑烷-3-基]-吡啶(啶菌噁唑)(K.1.37)、3-[5-(4-甲基苯基)-2,3-二甲基-异噁唑烷-3-基]-吡啶(K.1.38)、5-氯-1-(4,6-二甲氧基-嘧啶-2-基)-2-甲基-1H-苯并咪唑(K.1.39)、(Z)-3-氨基-2-氰基-3-苯基-丙-2-烯酸乙酯(K.1.40)、四唑吡氨酯(K.1.41)、N-[6-[[(Z)-[(1-甲基四唑-5-基)-苯基-亚甲基]氨基]氧基甲基]-2-吡啶基]氨基甲酸戊酯(K.1.42)、N-[6-[[(Z)-[(1-甲基四唑-5-基)-苯基-亚甲基]氨基]氧基甲基]-2-吡啶基]氨基甲酸丁-3-炔基酯(K.1.43)、伊氟芬喹(ipflufenoquin)(K.1.44)、氟菌喹啉(quinofumelin)(K.1.47)、噻霉酮(K.1.48)、溴菌腈(K.1.49)、2-(6-苄基-2-吡啶基)喹唑啉(K.1.50)、2-[6-(3-氟-4-甲氧基-苯基)-5-甲基-2-吡啶基]喹唑啉(K.1.51)、二氯菌噻(dichlobentiazox)(K.1.52)、N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒(K.1.53)、氨吡菌酯(K.1.54)、氟醚菌酰胺(K.1.55)、N'-[5-溴-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒(K.1.56)、N'-[4-(4,5-二氯噻唑-2-基)氧基-2,5-二甲基-苯基]-N-乙基-N-甲基-甲脒(K.1.57)、N-(2-氟苯基)-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺(K.1.58)、N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]硫代苯甲酰胺(K.1.59)、N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]环丙烷甲酰胺(WO 2018/177894、WO 2020/212513);

[0341] L)生物杀有害生物剂

[0342] L1)具有杀真菌、杀细菌、杀病毒和/或植物防御活化剂活性的微生物杀有害生物剂:白粉寄生孢、黄曲霉、出芽短梗霉菌、高地芽孢杆菌、解淀粉芽孢杆菌、解淀粉芽孢杆菌植物亚种(也称为贝莱斯芽孢杆菌)、巨大芽孢杆菌、莫海威芽孢杆菌、蕈状芽孢杆菌、短小芽孢杆菌、简单芽孢杆菌、盐土芽孢杆菌、枯草芽孢杆菌、解淀粉枯草芽孢杆菌变种、贝莱斯芽孢杆菌、橄榄假丝酵母、齐藤假丝酵母(C.saitoana)、番茄溃疡病菌(Clavibacter

michiganensis)(噬菌体)、盾壳霉、寄生隐丛赤壳菌、白色隐球菌、秃发双孢菌(Dilophosphora alopecuri)、尖孢镰刀菌、链孢粘帚霉(Clonostachys rosea f.catenulate)(也称为链孢粘帚菌(Gliocladium catenulatum))、粉红粘帚霉、抗生素溶杆菌、产霉溶杆菌、核果梅奇酵母、双胞镰孢(Microdochium dimerum)、小球壳孢、白色产气霉(Muscodor albus)、蜂房芽孢杆菌、附生类芽孢杆菌、多粘类芽孢杆菌、成团泛菌、拜赖青霉、大伏革菌、假单胞菌属物种、绿镇假单胞菌、絮状假酶菌(Pseudozyma flocculosa)、异常毕赤酵母、寡雄腐霉、球形孢子菌(Sphaerodes mycoparasitica)、灰绿链霉菌、利迪链霉菌、紫黑链霉菌、黄蓝状菌、类棘孢木霉(Trichoderma asperelloides)、棘孢木霉、深绿木霉、顶孢木霉、盖姆斯木霉、钩状木霉(T.harmatum)、哈茨木霉、多孢木霉(T.polysporum)、子座木霉(T.stromaticum)、绿木霉(T.virens)、绿色木霉(T.viride)、透根核瑚菌(Typhula phacorrhiza)、奥德曼细基格孢、大丽轮枝菌、小西葫芦黄花叶病毒(无毒菌株);

[0343] L2)具有杀真菌、杀细菌、杀病毒和/或植物防御活化剂活性的生物化学杀有害生物剂:超敏蛋白,大虎杖提取物;

[0344] L3)具有杀昆虫、杀螨、杀螺和/或杀线虫活性的微生物杀有害生物剂:放射形土壤杆菌、蜡样芽孢杆菌、坚强芽孢杆菌、苏云金芽孢杆菌、苏云金芽孢杆菌鲇泽亚种、苏云金芽孢杆菌以色列亚种、苏云金芽孢杆菌蜡螟亚种、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种、球孢白僵菌、布氏白僵菌、伯克霍尔德氏菌物种、活性紫色细菌(Chromobacterium subtsugae)、苹果蠹蛾颗粒体病毒(CpGV)、伪苹果蠹蛾颗粒体病毒(CrleGV)、黄杆菌属物种、棉铃虫核型多角体病毒(HearNPV)、玉米夜蛾核型多角体病毒(HzNPV)、玉米夜蛾单衣壳核型多角体病毒(HzSNPV)、嗜菌异小杆线虫、玫烟色棒束孢、长孢蜡蚧菌(Lecanicillium longisporum)、蝇蚧疥霉(L.muscarium)、金龟子绿僵菌、金龟子绿僵菌小孢变种、金龟子绿僵菌蝗变种、莱氏野村菌、玫烟色拟青霉、淡紫色拟青霉、日本甲虫类芽孢杆菌、巴斯德氏芽菌属物种、拟斯扎瓦巴氏杆菌、穿刺巴氏杆菌、分支巴斯德氏菌(P.ramosa)、李氏巴斯德氏菌(P.thornea)、乌斯巴斯德氏菌(P.usgae)、荧光假单胞菌、灰翅夜蛾核型多角体病毒(SpliNPV)、斯氏小卷蛾线虫、斯氏夜蛾线虫、锯蜂线虫、鲜黄链霉菌、细黄链霉菌;

[0345] L4)具有杀昆虫、杀螨、杀螺、信息素和/或杀线虫活性的生物化学杀有害生物剂:L-香芹酮、柠檬醛、乙酸(E,Z)-7,9-十二碳二烯-1-基酯、甲酸乙酯、(E,Z)-2,4-癸二烯酸乙酯(梨酯)、(Z,Z,E)-7,11,13-十六碳三烯醛、丁酸庚酯、肉豆蔻酸异丙酯、千里酸熏衣草酯、顺式-茉莉酮、2-甲基1-丁醇、甲基丁香酚、茉莉酮酸甲酯、(E,Z)-2,13-十八碳二烯-1-醇、乙酸(E,Z)-2,13-十八碳二烯-1-醇酯、(E,Z)-3,13-十八碳二烯-1-醇、(R)-1-辛烯-3-醇、白蚁信息素(pentatermanone)、乙酸(E,Z,Z)-3,8,11-十四碳三烯基酯、乙酸(Z,E)-9,12-十四碳二烯-1-基酯、(Z)-7-十四碳烯-2-酮、乙酸(Z)-9-十四碳烯-1-基酯、(Z)-11-十四碳烯醛、(Z)-11-十四碳烯-1-醇、土荆芥(Chenopodium ambrosiodes)提取物、印楝油、皂树(Quillay)提取物;

[0346] L5)具有植物胁迫降低、植物生长调节剂、植物生长促进和/或产量提高活性的微生物杀有害生物剂:无乳固氮螺菌、巴西固氮螺菌、生脂固氮螺菌、伊拉克固氮螺菌、高盐固氮螺菌、慢生根瘤菌属物种、埃氏慢生根瘤菌、大豆慢生根瘤菌、辽宁慢生根瘤菌、慢生羽扇豆根瘤菌、食酸戴尔福特菌、丛枝菌根真菌、中生根瘤菌属物种、豌豆根瘤菌菜豆生物型、豌

豆根瘤菌三叶草生物型、豌豆根瘤菌蚕豆生物型、热带根瘤菌和苜蓿中华根瘤菌；

[0347] 0)来自0.1至0.29类的杀昆虫剂

[0348] 0.1乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂:涕灭威、棉铃威、噁虫威、丙硫克百威、丁酮威、丁酮砜威、甲萘威、卡巴呋喃、丁硫克百威、乙硫苯威、仲丁威、伐虫脒、呋线威、异丙威、灭虫威、灭多虫、速灭威、杀线威、抗蚜威、残杀威、硫双威、久效威、混杀威、XMC、灭杀威、唑蚜威；高灭磷、甲基吡啶磷、乙基谷硫磷、谷硫磷、硫线磷、氯氧磷、毒虫畏、氯甲磷、毒死蜱、甲基毒死蜱、蝇毒磷、杀螟腈、内吸磷-S-甲基、二嗪农、敌敌畏/DDVP、百治磷、乐果、甲基毒虫畏、乙拌磷、EPN、乙硫磷、丙线磷、伐灭磷、苯线磷、杀螟松、倍硫磷、噻唑磷、庚烯磷、氰咪唑硫磷、异丙胺磷、O-(甲氧基氨基硫代-磷酰基)水杨酸异丙酯、异噁唑磷、马拉硫磷、灭蚜磷、甲胺磷、杀扑磷、速灭磷、久效磷、二溴磷、氧乐果、砜吸磷、对硫磷、甲基对硫磷、稻丰散、甲拌磷、伏杀磷、亚胺硫磷、磷胺、辛硫磷、甲基嘧啶磷、丙溴磷、烯虫磷、丙硫磷、吡唑硫磷、哒嗪硫磷、喹硫磷、治螟磷、丁基嘧啶磷、双硫磷、特丁磷、杀虫畏、甲基乙拌磷、三唑磷、敌百虫、蚜灭磷；

[0349] 0.2GABA门控氯离子通道拮抗剂:硫丹、氯丹;乙虫腈、氟虫腈、丁烯氟虫腈、啶吡唑虫胺(pyrafluprole)、吡唑虫啶(pyriprole)；

[0350] 0.3钠通道调节剂:氟丙菊酯、丙烯菊酯、右旋-顺式-反式丙烯菊酯、右旋反式丙烯菊酯、联苯菊酯、k-联苯菊酯、生物丙烯菊酯、生物丙烯菊酯S-环戊烯基、生物苄呋菊酯、乙氰菊酯、氟氯氰菊酯、β-氟氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯、λ-三氟氯氰菊酯、γ-三氟氯氰菊酯、氯氰菊酯、α-氯氰菊酯、β-氯氰菊酯、θ-氯氰菊酯、ζ-氯氰菊酯、苯醚氰菊酯、溴氰菊酯、烯炔菊酯、高氰戊菊酯、醚菊酯、甲氰菊酯、杀灭菊酯、氟氰戊菊酯、氟氯苯菊酯、τ-氟胺氰菊酯、溴氟醚菊酯、七氟甲醚菊酯、咪炔菊酯、氯氟醚菊酯、甲氧苄氟菊酯、甲氧氟菊酯、ε-甲氧氟菊酯、氯菊酯、苯醚菊酯、炔丙菊酯、丙氟菊酯、除虫菊酯(除虫菊)、灭虫菊、氟硅菊酯、七氟菊酯、κ-七氟菊酯、四氟醚菊酯、胺菊酯、四溴菊酯、四氟苯菊酯;DDT、甲氧滴滴涕；

[0351] 0.4烟碱型乙酰胆碱受体(nAChR)激动剂:啶虫脒、噻虫胺、环氧虫啶、呋虫胺、吡虫啉、烯啶虫胺、噻虫啉、噻虫嗪;4,5-二氢-N-硝基-1-(2-环氧乙烷基甲基)-1H-咪唑-2-胺、(2E)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-N'-硝基-2-亚戊基氨基胍;1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-7-甲基-8-硝基-5-丙氧基-1,2,3,5,6,7-六氢咪唑并[1,2-a]吡啶;烟碱;氟啶虫胺腈、氟吡呋喃酮、三氟苯嘧啶、(3R)-3-(2-氯噻唑-5-基)-8-甲基-5-氧代-6-苯基-2,3-二氢噻唑并[3,2-a]嘧啶-8-鎓-7-酚盐、(3S)-3-(6-氯-3-吡啶基)-8-甲基-5-氧代-6-苯基-2,3-二氢噻唑并[3,2-a]嘧啶-8-鎓-7-酚盐、(3S)-8-甲基-5-氧代-6-苯基-3-嘧啶-5-基-2,3-二氢噻唑并[3,2-a]嘧啶-8-鎓-7-酚盐、(3R)-3-(2-氯噻唑-5-基)-8-甲基-5-氧代-6-[3-(三氟甲基)苯基]-2,3-二氢噻唑并[3,2-a]嘧啶-8-鎓-7-酚盐;(3R)-3-(2-氯噻唑-5-基)-6-(3,5-二氯苯基)-8-甲基-5-氧代-2,3-二氢噻唑并[3,2-a]嘧啶-8-鎓-7-酚盐、(3R)-3-(2-氯噻唑-5-基)-8-乙基-5-氧代-6-苯基-2,3-二氢噻唑并[3,2-a]嘧啶-8-鎓-7-酚盐；

[0352] 0.5烟碱型乙酰胆碱受体变构活化剂:多杀菌素、乙基多杀菌素；

[0353] 0.6氯离子通道活化剂:阿巴美丁、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐、伊维菌素、雷皮菌素、弥拜菌素；

[0354] 0.7保幼激素模拟物:烯虫乙酯、烯虫炔酯、烯虫酯;苯氧威、蚊蝇醚；

[0355] 0.8各种各样非特异性(多位点)抑制剂:溴甲烷和其他烷基卤化物;三氯硝基甲

烷、磺酰氟、硼砂、吐酒石;

[0356] 0.9弦音器官TRPV通道调节剂:吡蚜酮、氟虫吡喹;

[0357] 0.10螨生长抑制剂:四螨嗪、噻螨酮、氟螨嗪;乙螨唑;

[0358] 0.11昆虫中肠膜的微生物干扰剂:苏云金芽孢杆菌、球形芽孢杆菌以及它们产生的杀昆虫蛋白:苏云金芽孢杆菌以色列亚种、球形芽孢杆菌、苏云金芽孢杆菌鲇泽亚种、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种,Bt作物蛋白:Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab1;

[0359] 0.12线粒体ATP合成酶抑制剂:丁醚脲;三唑锡、三环锡、苯丁锡、克螨特、三氯杀螨砜;

[0360] 0.13经由质子梯度干扰的氧化磷酸化去偶剂:溴虫腈、DNOC、氟虫胺;

[0361] 0.14烟碱型乙酰胆碱受体(nAChR)通道阻断剂:杀虫磺、杀螟丹、杀虫环、杀虫双;

[0362] 0.15甲壳素生物合成抑制剂0型:双三氟虫脲、氟啶脲、二氟脲、氟环脲、氟虫脲、氟铃脲、虱螨脲、氟酰脲、多氟脲、氟苯脲、杀铃脲;

[0363] 0.16甲壳素生物合成抑制剂1型:噻嗪酮;

[0364] 0.17蜕皮干扰剂:灭蝇胺;

[0365] 0.18蜕皮激素受体激动剂:甲氧虫酰肼、虫酰肼、氯虫酰肼、呋喃虫酰肼、环虫酰肼;

[0366] 0.19章鱼胺受体激动剂:双甲脒;

[0367] 0.20线粒体配合物III电子传输抑制剂:氟蚁腙、灭螨醌、嘧螨酯、联苯肼酯;

[0368] 0.21线粒体配合物I电子传输抑制剂:喹螨醚、唑螨酯、嘧螨醚、哒螨酮、吡螨胺、唑虫酰胺;鱼藤酮;

[0369] 0.22电压依赖型钠通道阻断剂:茚虫威、氰氟虫腙、2-[2-(4-氰基苯基)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]-N-[4-(二氟甲氧基)苯基]-肼甲酰胺、N-(3-氯-2-甲基苯基)-2-[(4-氯苯基)-[4-[甲基(甲基磺酰基)氨基]苯基]亚甲基]-肼甲酰胺;

[0370] 0.23乙酰辅酶A羧化酶抑制剂:螺螨酯、螺甲螨酯、螺虫乙酯、甲氧哌啶乙酯;

[0371] 0.24线粒体配合物IV电子传输抑制剂:磷化铝、磷化钙、膦、磷化锌、氰化物;

[0372] 0.25线粒体配合物II电子传输抑制剂:腈吡螨酯、丁氟螨酯;

[0373] 0.26利阿诺定受体调节剂:氟虫双酰胺、氯虫苯甲酰胺、溴氰虫酰胺、环溴虫酰胺、氟氰虫酰胺;(R)-3-氯-N^1-{2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基}-N^2-(1-甲基-2-甲基磺酰基乙基)酞酰胺、(S)-3-氯-N^1-{2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基}-N^2-(1-甲基-2-甲基磺酰基乙基)酞酰胺、甲基-2-[3,5-二溴-2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基}氨基)苯甲酰基]-1,2-二甲基肼羧酸酯;N-[4,6-二氯-2-[(二乙基-λ-4-亚硫烷基)氨基甲酰基]苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(三氟甲基)吡唑-3-甲酰胺;N-[4-氯-2-[(二乙基-λ-4-亚硫烷基)氨基甲酰基]-6-甲基-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(三氟甲基)吡唑-3-甲酰胺;N-[4-氯-2-[(二-2-丙基-λ-4-亚硫烷基)氨基甲酰基]-6-甲基-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(三氟甲基)吡唑-3-甲酰胺;N-[4,6-二氯-2-[(二-2-丙基-λ-4-亚硫烷基)氨基甲酰基]苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(三氟甲基)吡唑-3-甲酰胺;N-[4,6-二溴-2-[(二乙基-λ-4-亚硫烷基)氨基甲酰基]苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(三氟甲基)吡唑-3-甲酰胺;N-[2-(5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯

基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-甲酰胺;3-氯-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[2,4-二氯-6-[[(1-氰基-1-甲基乙基)氨基]羰基]苯基]-1H-吡唑-5-甲酰胺;四氯虫酰胺;N-[4-氯-2-[[(1,1-二甲基乙基)氨基]羰基]-6-甲基苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(氟甲氧基)-1H-吡唑-5-甲酰胺;氯氟氰虫酰胺;

[0374] 0.27:弦音器官调节剂-未限定的目标位点:氟啶虫酰胺;

[0375] 0.28.未知或不确定作用模式的杀昆虫化合物:双丙环虫酯、阿福拉纳、印楝素、磺胺螨酯、苯螨特、溴虫氟苯双酰胺、溴螨酯、灭螨猛、冰晶石、环丙氟虫胺(cyproflanilide)、二氯噻吡嘧啶、三氯杀螨醇、嘧虫胺、氟虫碳酸酯(flometoquin)、氟噻虫砜、氟己虫腈(fluhexafon)、氟吡菌酰胺、氟雷拉纳、噁虫酮、增效醚、吡唑酰苯胺(pyflubumide)、啶虫丙醚、线噻吩(tioxazafen)、11-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-12-羟基-1,4-二氧杂-9-氮杂二螺[4.2.4.2]十四碳-11-烯-10-酮、3-(4'-氟-2,4-二甲基二苯基-3-基)-4-羟基-8-氧杂-1-氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮、1-[2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亚磺酰基]苯基]-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺、坚强芽孢杆菌I-1582;氟虫啶胺(flupyrimin);三氟咪啶酰胺;4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(1-氧代硫杂环丁烷-3-基)苯甲酰胺;氟噁唑酰胺;5-[3-[2,6-二氯-4-(3,3-二氯烯丙氧基)苯氧基]丙氧基]-1H-吡唑;4-氰基-N-[2-氰基-5-[[2,6-二溴-4-[1,2,2,3,3,3-六氟-1-(三氟甲基)丙基]苯基]氨基甲酰基]苯基]-2-甲基-苯甲酰胺;4-氰基-3-[(4-氰基-2-甲基-苯甲酰基)氨基]-N-[2,6-二氯-4-[1,2,2,3,3,3-六氟-1-(三氟甲基)丙基]苯基]-2-氟-苯甲酰胺;N-[5-[[2-氯-6-氰基-4-[1,2,2,3,3,3-六氟-1-(三氟甲基)丙基]苯基]氨基甲酰基]-2-氰基-苯基]-4-氰基-2-甲基-苯甲酰胺;N-[5-[[2-溴-6-氯-4-[2,2,2-三氟-1-羟基-1-(三氟甲基)乙基]苯基]氨基甲酰基]-2-氰基-苯基]-4-氰基-2-甲基-苯甲酰胺;N-[5-[[2-溴-6-氯-4-[1,2,2,3,3,3-六氟-1-(三氟甲基)丙基]苯基]氨基甲酰基]-2-氰基-苯基]-4-氰基-2-甲基-苯甲酰胺;4-氰基-N-[2-氰基-5-[[2,6-二氯-4-[1,2,2,3,3,3-六氟-1-(三氟甲基)丙基]苯基]氨基甲酰基]苯基]-2-甲基-苯甲酰胺;4-氰基-N-[2-氰基-5-[[2,6-二氯-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基]氨基甲酰基]苯基]-2-甲基-苯甲酰胺;N-[5-[[2-溴-6-氯-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基]氨基甲酰基]-2-氰基-苯基]-4-氰基-2-甲基-苯甲酰胺;2-(1,3-二噁烷-2-基)-6-[2-(3-吡啶基)-5-噻唑基]-吡啶;2-[6-[2-(5-氟-3-吡啶基)-5-噻唑基]-2-吡啶基]-嘧啶;2-[6-[2-(3-吡啶基)-5-噻唑基]-2-吡啶基]-嘧啶;N-甲基磺酰基-6-[2-(3-吡啶基)噻唑-5-基]吡啶-2-甲酰胺;N-甲基磺酰基-6-[2-(3-吡啶基)噻唑-5-基]吡啶-2-甲酰胺;1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-1,2,3,5,6,7-六氢-5-甲氧基-7-甲基-8-硝基-咪唑并[1,2-a]吡啶;1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-7-甲基-8-硝基-1,2,3,5,6,7-六氢咪唑并[1,2-a]吡啶-5-醇;1-异丙基-N,5-二甲基-N-哒嗪-4-基-吡唑-4-甲酰胺;1-(1,2-二甲基丙基)-N-乙基-5-甲基-N-哒嗪-4-基-吡唑-4-甲酰胺;N,5-二甲基-N-哒嗪-4-基-1-(2,2,2-三氟-1-甲基-乙基)吡唑-4-甲酰胺;1-[1-(1-氰基环丙基)乙基]-N-乙基-5-甲基-N-哒嗪-4-基-吡唑-4-甲酰胺;N-乙基-1-(2-氟-1-甲基-丙基)-5-甲基-N-哒嗪-4-基-吡唑-4-甲酰胺;1-(1,2-二甲基丙基)-N,5-二甲基-N-哒嗪-4-基-吡唑-4-甲酰胺;1-[1-(1-氰基环丙基)乙基]-N,5-二甲基-N-哒嗪-4-基-吡唑-4-甲酰胺;N-甲基-1-(2-氟-1-甲基-丙基]-5-甲基-N-哒嗪-4-基-吡唑-4-甲酰胺;1-(4,4-二氟环己基)-N-乙基-5-甲基-N-哒嗪-4-基-吡唑-4-甲酰胺;1-(4,4-二氟环己基)-N,5-二甲基-N-

哒嗪-4-基-吡唑-4-甲酰胺、N-(1-甲基乙基)-2-(3-吡啶基)-2H-吲唑-4-甲酰胺;N-环丙基-2-(3-吡啶基)-2H-吲唑-4-甲酰胺;N-环己基-2-(3-吡啶基)-2H-吲唑-4-甲酰胺;2-(3-吡啶基)-N-(2,2,2-三氟乙基)-2H-吲唑-4-甲酰胺;2-(3-吡啶基)-N-[(四氢-2-呋喃基)甲基]-2H-吲唑-5-甲酰胺;2-[[2-(3-吡啶基)-2H-吲唑-5-基]羰基]肼甲酸甲酯;N-[(2,2-二氟环丙基)甲基]-2-(3-吡啶基)-2H-吲唑-5-甲酰胺;N-(2,2-二氟丙基)-2-(3-吡啶基)-2H-吲唑-5-甲酰胺;2-(3-吡啶基)-N-(2-嘧啶基甲基)-2H-吲唑-5-甲酰胺;N-[(5-甲基-2-吡嗪基)甲基]-2-(3-吡啶基)-2H-吲唑-5-甲酰胺、氯吡唑虫胺(tyclopyrazoflor);沙罗拉纳(sarolaner)、洛替拉纳(lotilaner)、N-[4-氯-3-[[(苯基甲基)氨基]羰基]苯基]-1-甲基-3-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-甲酰胺;2-(3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶、2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶、异噁唑虫酰胺、N-[4-氯-3-(环丙基氨基甲酰基)苯基]-2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-甲酰胺、N-[4-氯-3-[(1-氰基环丙基)氨基甲酰基]苯基]-2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-甲酰胺;氟螨啶(acynonapyr);苯嘧虫噁烷(benzpyrimoxan);替戈拉纳(tigolaner);氯-N-(1-氰基环丙基)-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]苯甲酰胺、噁唑磺酰虫啶、[(2S,3R,4R,5S,6S)-3,5-二甲氧基-6-甲基-4-丙氧基-四氢吡喃-2-基]-N-[4-[1-[4-(三氟甲氧基)苯基]-1,2,4-三唑-3-基]苯基]氨基甲酸酯、N-[4-[1-[4-(三氟甲氧基)苯基]-1,2,4-三唑-3-基]苯基]氨基甲酸[(2S,3R,4R,5S,6S)-3,4,5-三甲氧基-6-甲基-四氢吡喃-2-基]酯、[(2S,3R,4R,5S,6S)-3,5-二甲氧基-6-甲基-4-丙氧基-四氢吡喃-2-基]-N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-五氟乙氧基)苯基]-1,2,4-三唑-3-基]苯基]氨基甲酸酯、[(2S,3R,4R,5S,6S)-3,4,5-三甲氧基-6-甲基-四氢吡喃-2-基]-N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-五氟乙氧基)苯基]-1,2,4-三唑-3-基]苯基]氨基甲酸酯、(2Z)-3-(2-异丙基苯基)-2-[(E)-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-五氟乙氧基)苯基]-1,2,4-三唑-3-基]苯基]亚甲基亚肼基]噻唑烷-4-酮;2-(6-氯-3-乙基磺酰基-咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶、2-(6-溴-3-乙基磺酰基-咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶、2-(3-乙基磺酰基-6-碘-咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶、2-[3-乙基磺酰基-6-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶、2-(7-氯-3-乙基磺酰基-咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶、2-(3-乙基磺酰基-7-碘-咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶、3-乙基磺酰基-6-碘-2-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]咪唑并[1,2-a]吡啶-8-甲腈、2-[3-乙基磺酰基-8-氟-6-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶、2-[3-乙基磺酰基-7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基亚磺酰基)咪唑并[4,5-b]吡啶、2-[3-乙基磺酰基-7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶、2-(6-溴-3-乙基磺酰基-咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基)-6-(三氟甲基)吡唑并[4,3-c]吡啶。

[0376] 被称为组分2的活性物质、其制备及其例如抗有害真菌的活性是已知的(参见:http://www.alanwood.net/pesticides/);这些物质是可商购的。由IUPAC命名法描述的化合物、其制备及其杀有害生物活性也是已知的(参见Can.J.Plant Sci.[加拿大植物科学杂

志]48(6),587-94,1968;EP-A 141 317;EP-A 152 031;EP-A 226 917;EP-A 243 970;EP-A 256503;EP-A 428 941;EP-A 532 022;EP-A 1 028 125;EP-A 1 035 122;EP-A 1 201 648;EP-A 1 122 244,JP 2002316902;DE 19650197;DE 10021412;DE 102005009458;US 3,296,272;US 3,325,503;WO 98/46608;WO 99/14187;WO 99/24413;WO 99/27783;WO 00/29404;WO 00/46148;WO 00/65913;WO 01/54501;WO 01/56358;WO 02/22583;WO 02/40431;WO 03/10149;WO 03/11853;WO 03/14103;WO 03/16286;WO 03/53145;WO 03/61388;WO 03/66609;WO 03/74491;WO 04/49804;WO 04/83193;WO 05/120234;WO 05/123689;WO 05/123690;WO 05/63721;WO 05/87772;WO 05/87773;WO 06/15866;WO 06/87325;WO 06/87343;WO 07/82098;WO 07/90624,WO 10/139271,WO 11/028657,WO 12/168188,WO 07/006670,WO 11/77514;WO 13/047749,WO 10/069882,WO 13/047441,WO 03/16303,WO 09/90181,WO 13/007767,WO 13/010862,WO 13/127704,WO 13/024009,WO 13/24010,WO 13/047441,WO 13/162072,WO 13/092224,WO 11/135833,CN 1907024,CN 1456054,CN 103387541,CN 1309897,WO 12/84812,CN 1907024,WO 09094442,WO 14/60177,WO 13/116251,WO 08/013622,WO 15/65922,WO 94/01546,EP 2865265,WO 07/129454,WO 12/165511,WO 11/081174,WO 13/47441,WO 16/156241,WO 16/162265)。一些化合物通过其CAS登记号来标识,该登记号被连字符分成三个部分,第一部分由两个至七个数字组成,第二部分由两个数字组成,并且第三部分由单个数字组成。

[0377] 根据本发明,生物杀有害生物剂(油如印楝油等除外)的固体材料(干物质)被认为是活性组分(例如在微生物杀有害生物剂的液体配制品的情况下在干燥或蒸发提取或悬浮介质之后得到)。对生物提取物如皂树提取物所使用的重量比和百分比基于相应提取物的干含量(固体材料)的总重量。

[0378] 以活微生物细胞形式(包括休眠形式)包含至少一种微生物杀有害生物剂的组合物的总重量比可以使用相应微生物的CFU的量来用以下等式计算相应活性组分的总重量来确定:1×10^{10}CFU等于一克相应活性组分的总重量。菌落形成单位是活微生物细胞的量度。此外,"CFU"在线虫生物杀有害生物剂如斯氏夜蛾线虫(Steinernema feltiae)的情况下还可以理解为(幼年)个体线虫的数目。

[0379] 在二元混合物中,组分1)与组分2)的重量比通常取决于所使用的组分的特性,通常其在1:10,000至10,000:1、时常在1:100至100:1、经常在1:50至50:1、优选在1:20至20:1、更优选在1:10至10:1、甚至更优选在1:4至4:1、并且特别是在1:2至2:1的范围内。根据另一个实施例,组分1)与组分2)的重量比通常在1000:1至1:1、时常在100:1至1:1、经常在50:1至1:1、优选在20:1至1:1、更优选在10:1至1:1、甚至更优选在4:1至1:1、并且特别是在2:1至1:1的范围内。根据另一个实施例,组分1)与组分2)的重量比通常在20,000:1至1:10、时常在10,000:1至1:1、经常在5,000:1至5:1、优选在5,000:1至10:1、更优选在2,000:1至30:1、甚至更优选在2,000:1至100:1、并且特别是在1,000:1至100:1的范围内。根据另一个实施例,组分1)与组分2)的重量比通常在1:1至1:1000、时常在1:1至1:100、经常在1:1至1:50、优选在1:1至1:20、更优选在1:1至1:10、甚至更优选在1:1至1:4、并且特别是在1:1至1:2的范围内。根据另一个实施例,组分1)与组分2)的重量比通常在10:1至1:20,000、时常在1:1至1:10,000、经常在1:5至1:5,000、优选在1:10至1:5,000、更优选在1:30至1:2,000、甚至更优选在1:100至1:2,000、并且特别是在1:100至1:1,000的范围内。

[0380] 在三元混合物,即包含组分1)和组分2)和化合物III(组分3)的组合物中,组分1)与组分2)的重量比取决于所使用的活性物质的特性,通常其在1:100至100:1、经常在1:50至50:1、优选在1:20至20:1、更优选在1:10至10:1、并且特别是在1:4至4:1的范围内,并且组分1)与组分3)的重量比通常在1:100至100:1、经常在1:50至50:1、优选在1:20至20:1、更优选在1:10至10:1、并且特别是在1:4至4:1的范围内。如果需要,任何另外活性组分以20:1至1:20的比率添加到组分1)中。这些比率也适合于通过种子处理施用的混合物。

[0381] 当包含微生物杀有害生物剂的混合物用于作物保护时,施用率范围为1×10^{6}至5×10^{16}(或更大)CFU/ha、优选1×10^{8}至1×10^{13}CFU/ha,并且甚至更优选1×10^{9}至5×10^{15}CFU/ha、并且特别是1×10^{12}至5×10^{14}CFU/ha。在线虫作为微生物杀有害生物剂(例如斯氏夜蛾线虫)的情况下,施用率范围经常为1×10^{5}至1×10^{12}(或更大)、优选1×10^{8}至1×10^{11}、更优选5×10^{8}至1×10^{10}个个体(例如呈卵、幼虫或任何其他活体阶段形式,优选处于非繁殖性(infetive)幼虫阶段)/ha。

[0382] 当包含微生物杀有害生物剂的混合物用于种子处理时,施用率范围通常为1×10^{6}至1×10^{12}(或更大)CFU/种子、优选1×10^{6}至1×10^{9}CFU/种子。此外,关于种子处理的施用率范围通常为1×10^{7}至1×10^{14}(或更大)CFU/100kg种子、优选1×10^{9}至1×10^{12}CFU/100kg种子。

[0383] 优选的是包含作为组分2)的至少一种活性物质的混合物,该至少一种活性物质选自组A)的在Q_o位点的配合物III抑制剂,更优选地选自化合物(A.1.1)、(A.1.4)、(A.1.8)、(A.1.9)、(A.1.10)、(A.1.12)、(A.1.13)、(A.1.14)、(A.1.17)、(A.1.21)、(A.1.25)、(A.1.34)和(A.1.35);特别地选自(A.1.1)、(A.1.4)、(A.1.8)、(A.1.9),(A.1.13)、(A.1.14)、(A.1.17)、(A.1.25)、(A.1.34)和(A.1.35)。

[0384] 还优选的是包含作为组分2)的至少一种活性物质的混合物,该至少一种活性物质选自组A)的在Q_i位点的配合物III抑制剂,更优选地选自化合物(A.2.1)、(A.2.3)、(A.2.4)和(A.2.6);特别地选自(A.2.3)、(A.2.4)和(A.2.6)。

[0385] 还优选的是包含作为组分2)的至少一种活性物质的混合物,该至少一种活性物质选自组A)的配合物II抑制剂,更优选地选自化合物(A.3.2)、(A.3.3)、(A.3.4)、(A.3.7)、(A.3.9)、(A.3.11)、(A.3.12)、(A.3.15)、(A.3.16)、(A.3.17)、(A.3.18)、(A.3.19)、(A.3.20)、(A.3.21)、(A.3.22)、(A.3.23)、(A.3.24)、(A.3.28)、(A.3.31)、(A.3.32)、(A.3.33)、(A.3.34)、(A.3.35)、(A.3.36)、(A.3.37)、(A.3.38)和(A.3.39);特别地选自(A.3.2)、(A.3.3)、(A.3.4)、(A.3.7)、(A.3.9)、(A.3.12)、(A.3.15)、(A.3.17)、(A.3.19)、(A.3.22)、(A.3.23)、(A.3.24)、(A.3.31)、(A.3.32)、(A.3.33)、(A.3.34)、(A.3.35)、(A.3.36)、(A.3.37)、(A.3.38)和(A.3.39)。

[0386] 还优选的是包含作为组分2)的至少一种活性物质的混合物,该至少一种活性物质选自组A)的其他呼吸抑制剂,更优选地选自化合物(A.4.5)和(A.4.11);特别是(A.4.11)。

[0387] 还优选的是包含作为组分2)的至少一种活性物质的混合物,该至少一种活性物质选自组B)的C14脱甲基酶抑制剂,更优选地选自化合物(B.1.4)、(B.1.5)、(B.1.8)、(B.1.10)、(B.1.11)、(B.1.12)、(B.1.13)、(B.1.17)、(B.1.18)、(B.1.21)、(B.1.22)、(B.1.23)、(B.1.25)、(B.1.26)、(B.1.29)、(B.1.34)、(B.1.37)、(B.1.38)、(B.1.43)、(B.1.46)、(B.1.53)、(B.1.54)和(B.1.55);特别地选自(B.1.5)、(B.1.8)、(B.1.10)、

(B.1.17)、(B.1.22)、(B.1.23)、(B.1.25)、(B.1.33)、(B.1.34)、(B.1.37)、(B.1.38)、(B.1.43)和(B.1.46)。

[0388] 还优选的是包含作为组分2)的至少一种活性物质的混合物,该至少一种活性物质选自组B)的δ14-还原酶抑制剂,更优选地选自化合物(B.2.4)、(B.2.5)、(B.2.6)和(B.2.8);特别是(B.2.4)。

[0389] 还优选的是包含作为组分2)的至少一种活性物质的混合物,该至少一种活性物质选自组C)的苯基酰胺和酰基氨基酸杀真菌剂,更优选地选自化合物(C.1.1)、(C.1.2)、(C.1.4)和(C.1.5);特别地选自(C.1.1)和(C.1.4)。

[0390] 还优选的是包含作为组分2)的至少一种活性物质的混合物,该至少一种活性物质选自组C)的其他核酸合成抑制剂,更优选地选自化合物(C.2.6)、(C.2.7)和(C.2.8)。

[0391] 还优选的是包含作为组分2)的至少一种活性物质的混合物,该至少一种活性物质选自组D),更优选地选自化合物(D.1.1)、(D.1.2)、(D.1.5)、(D.2.4)和(D.2.6);特别地选自(D.1.2)、(D.1.5)和(D.2.6)。

[0392] 还优选的是包含作为组分2)的至少一种活性物质的混合物,该至少一种活性物质选自组E),更优选地选自化合物(E.1.1)、(E.1.3)、(E.2.2)和(E.2.3);特别是(E.1.3)。

[0393] 还优选的是包含作为组分2)的至少一种活性物质的混合物,该至少一种活性物质选自组F),更优选地选自化合物(F.1.2)、(F.1.4)和(F.1.5)。

[0394] 还优选的是包含作为组分2)的至少一种活性物质的混合物,该至少一种活性物质选自组G),更优选地选自化合物(G.3.1)、(G.3.3)、(G.3.6)、(G.5.1)、(G.5.3)、(G.5.4)、(G.5.5)、G.5.6)、G.5.7)、(G.5.8)、(G.5.9)、(G.5.10)和(G.5.11);特别地选自(G.3.1)、(G.5.1)和(G.5.3)。

[0395] 还优选的是包含作为组分2)的至少一种活性物质的混合物,该至少一种活性物质选自组H),更优选地选自化合物(H.2.2)、(H.2.3)、(H.2.5)、(H.2.7)、(H.2.8)、(H.3.2)、(H.3.4)、(H.3.5)、(H.4.9)和(H.4.10);特别地选自(H.2.2)、(H.2.5)、(H.3.2)、(H.4.9)和(H.4.10)。

[0396] 还优选的是包含作为组分2)的至少一种活性物质的混合物,该至少一种活性物质选自组I),更优选地选自化合物(I.2.2)和(I.2.5)。

[0397] 还优选的是包含作为组分2)的至少一种活性物质的混合物,该至少一种活性物质选自组J),更优选地选自化合物(J.1.2)、(J.1.5)、(J.1.8)、(J.1.11)和(J.1.12);特别是(J.1.5)。

[0398] 还优选的是包含作为组分2)的至少一种活性物质的混合物,该至少一种活性物质选自组K),更优选地选自化合物(K.1.41)、(K.1.42)、(K.1.44)、(K.1.47)、(K.1.57)、(K.1.58)和(K.1.59);特别地选自(K.1.41)、(K.1.44)、(K.1.47)、(K.1.57)、(K.1.58)和(K.1.59)。

[0399] 来自组L1)和/或L2)的生物杀有害生物剂还可以具有杀昆虫、杀螨、杀螺、信息素、杀线虫、植物胁迫降低、植物生长调节剂、植物生长促进和/或产量提高活性。来自组L3)和/或L4)的生物杀有害生物剂还可以具有杀真菌、杀细菌、杀病毒、植物防御活化剂、植物胁迫降低、植物生长调节剂、植物生长促进和/或产量提高活性。来自组L5)的生物杀有害生物剂还可以具有杀真菌、杀细菌、杀病毒、植物防御活化剂、杀昆虫、杀螨、杀螺、信息素和/或杀

线虫活性。

[0400] 微生物杀有害生物剂,特别是来自组L1)、L3)和L5)的那些,不仅包括如本文定义的相应微生物的分离的纯培养物,而且包括其无细胞提取物、其在全肉汤培养物和含代谢物的培养基中的悬浮液、或从微生物的全肉汤培养物获得的纯化的代谢物。

[0401] 这些生物杀有害生物剂中的许多以本文所提及的保藏号保藏(前缀如ATCC或DSM是指相应培养物保藏的首字母缩写,详情在这里参见例如:http://www.wfcc.info/ccinfo/collection/by_acronym/),在文献中被提及,被注册和/或可商购:出芽短梗霉DSM 14940和DSM 14941的混合物于1989年在德国康斯坦茨分离(例如芽生孢子,来自奥地利bio-ferm有限公司的BlossomProtect®),巴西固氮螺菌Sp245至少在1980年以前最初在巴西南部(帕苏风杜)的小麦区分离(BR 11005;例如来自巴西巴斯夫农业产品有限公司(BASF Agricultural Specialties Ltd.)的GELFIX®Gramíneas),巴西固氮螺菌菌株Ab-V5和Ab-V6(例如来自巴西夸特鲁巴拉斯Novozymes BioAg Produtos papra Agricultura Ltda.的AzoMax或来自巴西Simbiose-Agro的Simbiose-Maíz®;Plant Soil 331,413-425,2010),解淀粉芽孢杆菌菌株AP-188(NRRL B-50615和B-50331;US 8,445,255);解淀粉芽孢杆菌植物亚种菌株,以前有时也被称为枯草芽孢杆菌,最近与甲基营养型芽孢杆菌(B.methylotrophicus)和贝莱斯芽孢杆菌一起被归类为贝莱斯芽孢杆菌(Int.J.Syst.Evol.Microbiol.[国际系统与进化微生物学杂志]66,1212-1217,2016);在日本菊川市从空气中分离的解淀粉芽孢杆菌植物亚种或贝莱斯芽孢杆菌D747(US20130236522 A1;FERM BP-8234;例如来自美国Certis LLC的Double Nickel™55WDG),在德国勃兰登堡从土壤中分离的解淀粉芽孢杆菌植物亚种或贝莱斯芽孢杆菌FZB24(也称为SB3615;DSM 96-2;J.Plant Dis.Prot.[植物病害与防治杂志]105,181-197,1998;例如来自美国诺维信生物公司(Novozyme Biologicals,Inc.)的Taegro®),在德国勃兰登堡从土壤中分离的解淀粉芽孢杆菌植物亚种或贝莱斯芽孢杆菌FZB42(DSM 23117;J.Plant Dis.Prot.[植物病害与防治杂志]105,181-197,1998;例如来自德国AbiTEP有限公司的RhizoVital®42),至少在1988年以前在英国诺丁汉郡Sutton Bonington从蚕豆中分离的解淀粉芽孢杆菌植物亚种或贝莱斯芽孢杆菌MBI600(也被称为1430;NRRL B-50595;US2012/0149571 A1;例如来自美国巴斯夫公司的Integral®),1995年在美国加利福尼亚从桃园分离的解淀粉芽孢杆菌植物亚种或贝莱斯芽孢杆菌QST-713(NRRL B-21661;例如来自美国拜耳作物科学公司(Bayer Crop Science LP)的Serenade®MAX),1992年在美国南达科他州(South Dakoda)分离的解淀粉芽孢杆菌植物亚种或贝莱斯芽孢杆菌TJ1000(也被称为1BE;ATCC BAA-390;CA 2471555 A1;例如来自美国南达科他州沃特敦TJ Technologies的QuickRoots™);坚强芽孢杆菌CNCM I-1582,由以色列中原地区的土壤分离的亲代菌株EIP-N1的变体(CNCM I-1556)(WO 2009/126473,US 6,406,690;例如来自美国拜耳作物科学有限合伙公司(Bayer CropScience LP)的Votivo®),短小芽孢杆菌GHA 180在墨西哥由苹果树根际分离(IDAC 260707-01;例如来自加拿大魁北克Premier Horticulture的PRO-MIX®BX),另外称为BU-F22和BU-F33的短小芽孢杆菌INR-7至少在1993年以前由嗜维管束欧文氏菌(Erwinia tracheiphila)侵染的黄瓜分离(NRRL B-

50185、NRRL B-50153;US 8,445,255),短小芽孢杆菌KFP9F至少在2008年以前在南非由禾草根际分离(NRRL B-50754;WO 2014/029697;例如来自南非巴斯夫农业产品有限公司(BASF Agricultural Specialities(Pty)Ltd.)的BAC-UP或FUSION-P),短小芽孢杆菌QST 2808于1998年由在密克罗尼西亚联邦波纳佩(Pohnpei,Federated States of Micronesia)采集的土壤分离(NRRL B-30087;例如来自美国拜耳作物科学公司的Sonata®或Ballad® Plus),简单芽孢杆菌ABU 288(NRRL B-50304;US 8,445,255),也称为UD 1022或UD10-22的枯草芽孢杆菌FB17在北美由红甜菜根分离(ATCC PTA-11857;System.Appl.Microbiol.[系统和应用微生物学]27,372-379,2004;US 2010/0260735;WO 2011/109395);苏云金芽孢杆菌鲇泽亚种ABTS-1857于1987年由取自美国威斯康星州以法莲(Ephraim)草坪的土壤分离(也称为ABG-6346;ATCC SD-1372;例如来自德国明辛根BioFa AG的XenTari®),苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种ABTS-351等同于在1967年由美国德克萨斯州布朗斯维尔的患病棉红铃虫黑幼虫分离的HD-1(ATCC SD-1275;例如来自美国伊利诺伊州Valent BioSciences的Dipel® DF),苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种SB4由非洲茎螟(E.saccharina)幼虫尸体分离(NRRL B-50753;例如来自南非巴斯夫农业产品有限公司(BASF Agricultural Specialities(Pty)Ltd.)的Beta Pro®),苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种NB-176-1,菌株NB-125的突变体,于1982年由甲虫大黄粉虫的死蛹分离的野生型菌株(DSM 5480;EP 585 215B1;例如来自瑞士Valent BioSciences的Novodor®),球孢白僵菌GHA(ATCC 74250;例如来自美国Laverlam Int.Corp.的BotaniGard® 22WGP),球孢白僵菌JW-1(ATCC 74040;例如来自意大利CBC(Europe)S.r.l.的Naturalis®),球孢白僵菌PPRI 5339由龟甲虫Conchyloctenia punctata的幼虫分离(NRRL 50757;例如来自南非巴斯夫农业产品有限公司(BASF Agricultural Specialities(Pty)Ltd.)的BroadBand®),埃氏慢生根瘤菌菌株SEMIA 5019(也称为29W)在巴西里约热内卢分离并且SEMIA 587于1967年在南里奥格兰德州(State of Rio Grande do Sul)分离,来自先前用北美分离物接种的区域,并且自1968年开始用于商用接种体(Appl.Environ.Microbiol.[应用与环境微生物学]73(8),2635,2007;例如来自巴西巴斯夫农业产品有限公司(BASF Agricultural Specialties Ltd.)的GELFIX 5),大豆慢生根瘤菌532c由美国威斯康星州田间分离(Nitragin 61A152;Can.J.Plant.Sci.[加拿大植物科学杂志]70,661-666,1990;例如来自加拿大巴斯夫农业产品有限公司(BASF Agricultural Specialties Ltd.)的Rhizoflo®、Histick®、Hicoat® Super),菌株USDA 138的大豆慢生根瘤菌E-109变体(INTA E109,SEMIA 5085;Eur.J.Soil Biol.[欧洲土壤生物学杂志]45,28-35,2009;Biol.Fertil.Soils[土壤的生物学和肥力]47,81-89,2011);由Appl.Environ.Microbiol.[应用与环境微生物学]73(8),2635,2007已知保藏在SEMIA的大豆慢生根瘤菌菌株:SEMIA 5079在巴西塞拉多(Cerrados)区由Embrapa-Cerrados由土壤分离,自1992开始用于商用接种体(CPAC 15;例如来自巴西巴斯夫农业产品有限公司(BASF Agricultural Specialties Ltd.)的GELFIX 5或ADHERE 60),大豆慢生根瘤菌SEMIA 5080在巴西由Embrapa-Cerrados在实验室条件下得到并且自1992年开始用于商用接种体,为最初在美国分离的SEMIA 586的天然变体(CB1809)(CPAC 7;例如来自巴西巴斯夫农业产品有限公司(BASF

Agricultural Specialties Ltd.)的GELFIX 5或ADHERE 60);伯克霍尔德氏菌物种A396于2008年在日本日光由土壤分离(NRRL B-50319;WO 2013/032693;美国马罗尼生物创新公司(Marrone Bio Innovations,Inc.)),盾壳霉CON/M/91-08由油籽油菜分离(WO 1996/021358;DSM 9660;例如来自德国拜耳作物科学股份公司(Bayer CropScience AG)的Contans®WG、Intercept®WG),超敏蛋白(α-β)蛋白(Science[科学]257,85-88,1992;例如来自英国植物保健公司(Plant Health Care plc)的Messenger™或HARP-N-Tek),棉铃虫核型多角体病毒(HearNPV)(J.Invertebrate Pathol[无脊椎动物病理学杂志].107,112-126,2011;例如来自瑞士Adermatt Biocontrol的Helicovex®;来自巴西科伯特(Koppert)的Diplomata®;来自澳大利亚昆士兰AgBiTech Pty Ltd.的Vivus®Max),玉米夜蛾单衣壳核型多角体病毒(HzSNPV)(例如来自美国Certis LLC的Gemstar®),玉米夜蛾核型多角体病毒ABA-NPV-U(例如来自澳大利亚昆士兰AgBiTech Pty Ltd.的Heligen®),嗜菌异小杆线虫(例如来自英国巴斯夫农业产品有限公司(BASF Agricultural Specialities Limited)的Nemasys®G),玫烟色棒束孢Apopka-97在美国佛罗里达州阿波普卡由紫背天葵上的粉蚧分离(ATCC 20874;Biocontrol Science Technol[生物防治科学与技术].22(7),747-761,2012;例如来自美国Certis LLC的PFR-97™或PreFeRal®),也称为275或V275的金龟子绿僵菌小孢变种F52在奥地利由苹果蠹蛾分离(DSM 3884,ATCC 90448;例如Met52®Novozymes Biologicals BioAg Group,加拿大),核果梅奇酵母277在以色列中部地区由葡萄分离(US 6,994,849;NRRL Y-30752;例如以前的来自以色列Agrogreen的Shemer®),淡紫色拟青霉251在菲律宾由感染的线虫卵分离(AGAL 89/030550;WO 1991/02051;Crop Protection[作物保护]27,352-361,2008;例如来自德国拜耳作物科学股份公司的BioAct®和来自美国Certis的MeloCon®),蜂房芽孢杆菌NAS6G6至少在2008年以前在南非由禾草根际分离(WO 2014/029697;NRRL B-50755;例如来自南非巴斯夫农业产品有限公司(BASF Agricultural Specialities(Pty)Ltd.)的BAC-UP),从各欧洲地区包括德国的土壤样品中分离的类芽孢杆菌菌株:附生类芽孢杆菌Lu17015(WO 2016/020371;DSM 26971),多粘类芽孢杆菌植物亚种Lu16774(WO 2016/020371;DSM 26969),多粘类芽孢杆菌植物亚种菌株Lu17007(WO 2016/020371;DSM 26970);拟斯扎瓦巴氏杆菌Pn1于2000年代中期在美国伊利诺斯州由大豆田分离(ATCC SD-5833;Federal Register[联邦公报]76(22),5808,2011年2月2日;例如来自美国先正达作物保护有限公司(Syngenta Crop Protection,LLC)的Clariva™PN),拜赖青霉(也称为P.bilaii)菌株ATCC 18309(=ATCC 74319)、ATCC 20851和/或ATCC 22348(=ATCC 74318)最初在加拿大亚伯达由土壤分离(Fertilizer Res[肥料研究].39,97-103,1994;Can.J.Plant Sci.[加拿大植物科学杂志]78(1),91-102,1998;US 5,026,417,WO 1995/017806;例如来自加拿大Novozymes Biologicals BioAg Group的Jump Start®、Provide®),大虎杖提取物(EP 0307510 B1;例如来自美国加利福尼亚州戴维斯马罗尼生物创新公司(Marrone BioInnovations,Davis,CA,USA)的Regalia®SC或来自德国BioFa AG的Milsana®),斯氏小卷蛾线虫(例如来自英国巴斯夫农业产品有限公司

(BASF Agricultural Specialities Limited)的Millenium®),斯氏夜蛾线虫(例如来自美国BioWorks,Inc.的Nemashield®;来自英国巴斯夫农业产品有限公司(BASF Agricultural Specialities Limited)的Nemasys®),细黄链霉菌NRRL B-50550(WO 2014/124369;德国拜耳作物科学公司),类棘孢木霉JM41R在南非分离(NRRL 50759;也称为顶孢木霉;例如来自南非巴斯夫农业产品有限公司(BASF Agricultural Specialities (Pty)Ltd.)的Trichoplus®),哈茨木霉T-22也称为KRL-AG2(ATCC 20847;BioControl[生物防治]57,687-696,2012;例如来自美国BioWorks Inc.的Plantshield®或来自美国俄亥俄州范沃特Advanced Biological Marketing Inc.的SabrExTM)。

[0402] 根据混合物的另一个实施例,至少一种杀有害生物剂II选自组L1)至L5):

[0403] L1)具有杀真菌、杀细菌、杀病毒和/或植物防御活化剂活性的微生物杀有害生物剂:出芽短梗霉DSM 14940和DSM 14941(L1.1)、解淀粉芽孢杆菌AP-188(L.1.2)、解淀粉芽孢杆菌植物亚种D747(L.1.3)、解淀粉芽孢杆菌植物亚种FZB24(L.1.4)、解淀粉芽孢杆菌植物亚种FZB42(L.1.5)、解淀粉芽孢杆菌植物亚种MBI600(L.1.6)、解淀粉芽孢杆菌植物亚种QST-713(L.1.7)、解淀粉芽孢杆菌植物亚种TJ1000(L.1.8)、短小芽孢杆菌GB34(L.1.9)、短小芽孢杆菌GHA 180(L.1.10)、短小芽孢杆菌INR-7(L.1.11)、短小芽孢杆菌KFP9F(L.1.12)、短小芽孢杆菌QST 2808(L.1.13)、简单芽孢杆菌ABU 288(L.1.14)、枯草芽孢杆菌FB17(L.1.15)、盾壳霉CON/M/91-08(L.1.16)、核果梅奇酵母NRRL Y-30752(L.1.17)、蜂房芽孢杆菌NAS6G6(L.1.18)、附生类芽孢杆菌Lu17015(L.1.25)、多粘类芽孢杆菌植物亚种Lu16774(L.1.26)、多粘类芽孢杆菌植物亚种菌株Lu17007(L.1.27)、拜赖青霉ATCC 22348(L.1.19)、拜赖青霉ATCC 20851(L.1.20)、拜赖青霉ATCC 18309(L.1.21)、细黄链霉菌NRRL B-50550(L.1.22)、类棘孢木霉JM41R(L.1.23)、哈茨木霉T-22(L.1.24);

[0404] L2)具有杀真菌、杀细菌、杀病毒和/或植物防御活化剂活性的生物化学杀有害生物剂:超敏蛋白(L.2.1)、大虎杖提取物(L.2.2);

[0405] L3)具有杀昆虫、杀螨、杀螺和/或杀线虫活性的微生物杀有害生物剂:坚强芽孢杆菌I-1582(L.3.1);苏云金芽孢杆菌鲇泽亚种ABTS-1857(L.3.2)、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种ABTS-351(L.3.3)、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种SB4(L.3.4)、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种NB-176-1(L.3.5)、球孢白僵菌GHA(L.3.6)、球孢白僵菌JW-1(L.3.7)、球孢白僵菌PPRI 5339(L.3.8)、伯克霍尔德氏菌物种A396(L.3.9)、棉铃虫核型多角体病毒(HearNPV)(L.3.10)、玉米夜蛾核型多角体病毒(HzNPV)ABA-NPV-U(L.3.11)、玉米夜蛾单衣壳核型多角体病毒(HzSNPV)(L.3.12)、嗜菌异小杆线虫(Heterohabditis bacteriophora)(L.3.13)、玫烟色棒束孢Apopka-97(L.3.14)、金龟子绿僵菌小孢变种F52(L.3.15)、淡紫色拟青霉251(L.3.16)、拟斯扎瓦巴氏杆菌Pn1(L.3.17)、斯氏小卷蛾线虫(L.3.18)、斯氏夜蛾线虫(L.3.19);

[0406] L4)具有杀昆虫、杀螨、杀螺、信息素和/或杀线虫活性的生物化学杀有害生物剂:顺式-茉莉酮(L.4.1)、茉莉酮酸甲酯(L.4.2)、皂树提取物(L.4.3);

[0407] L5)具有植物胁迫降低、植物生长调节剂、植物生长促进和/或产量提高活性的微生物杀有害生物剂:巴西固氮螺菌Ab-V5和Ab-V6(L.5.1)、巴西固氮螺菌Sp245(L.5.2)、埃氏慢生根瘤菌SEMIA 587(L.5.3)、埃氏慢生根瘤菌SEMIA 5019(L.5.4)、大豆慢生根瘤菌

(B.japonicum)532c(L.5.5)、大豆慢生根瘤菌E-109(L.5.6)、大豆慢生根瘤菌SEMIA 5079(L.5.7)、大豆慢生根瘤菌SEMIA 5080(L.5.8)。

[0408] 此外,本发明涉及农用化学组合物,其包含以下项的混合物:至少一种化合物I(组分1)和至少一种选自组L)的生物杀有害生物剂(组分2)、特别是至少一种选自如上所述的组L1)和L2)的生物杀有害生物剂、以及(如果需要)至少一种合适的助剂。

[0409] 此外,本发明涉及农用化学组合物,其包含以下项的混合物:至少一种化合物I(组分1)和至少一种选自组L)的生物杀有害生物剂(组分2)、特别是至少一种选自如上所述的组L3)和L4)的生物杀有害生物剂、以及(如果需要)至少一种合适的助剂。

[0410] 还优选的是包含作为杀有害生物剂II(组分2)的生物杀有害生物剂的混合物,该生物杀有害生物剂选自组L1)、L3)和L5),优选地选自上文表示为(L.1.2)、(L.1.3)、(L.1.4)、(L.1.5)、(L.1.6)、(L.1.7)、(L.1.8)、(L.1.10)、(L.1.11)、(L.1.12)、(L.1.13)、(L.1.14)、(L.1.15)、(L.1.17)、(L.1.18)、(L.1.19)、(L.1.20)、(L.1.21)、(L.1.25)、(L.1.26)、(L.1.27)、(L.3.1);(L.3.9)、(L.3.16)、(L.3.17)、(L.5.1)、(L.5.2)、(L.5.3)、(L.5.4)、(L.5.5)、(L.5.6)、(L.5.7)、(L.5.8);(L.4.2)和(L.4.1)的菌株;甚至更优选地选自(L.1.2)、(L.1.6)、(L.1.7)、(L.1.8)、(L.1.11)、(L.1.12)、(L.1.13)、(L.1.14)、(L.1.15)、(L.1.18)、(L.1.19)、(L.1.20)、(L.1.21)、(L.3.1);(L.3.9)、(L.3.16)、(L.3.17)、(L.5.1)、(L.5.2)、(L.5.5)、(L.5.6);(L.4.2)和(L.4.1)。这些混合物特别适合用于处理繁殖材料,即种子处理目的,并且同样适用于土壤处理。这些种子处理混合物特别适合用于作物如谷物、玉米和豆科植物如大豆。

[0411] 还优选的是包含作为杀有害生物剂II(组分2)的生物杀有害生物剂的混合物,该生物杀有害生物剂选自组L1)、L3)和L5),优选地选自上文表示为(L1.1)、(L.1.2)、(L.1.3)、(L.1.6)、(L.1.7)、(L.1.9)、(L.1.11)、(L.1.12)、(L.1.13)、(L.1.14)、(L.1.15)、(L.1.17)、(L.1.18)、(L.1.22)、(L.1.23)、(L.1.24)、(L.1.25)、(L.1.26)、(L.1.27)、(L.2.2);(L.3.2)、(L.3.3)、(L.3.4)、(L.3.5)、(L.3.6)、(L.3.7)、(L.3.8)、(L.3.10)、(L.3.11)、(L.3.12)、(L.3.13)、(L.3.14)、(L.3.15)、(L.3.18)、(L.3.19);(L.4.2)的菌株,甚至更优选地选自(L.1.2)、(L.1.7)、(L.1.11)、(L.1.13)、(L.1.14)、(L.1.15)、(L.1.18)、(L.1.23)、(L.3.3)、(L.3.4)、(L.3.6)、(L.3.7)、(L.3.8)、(L.3.10)、(L.3.11)、(L.3.12)、(L.3.15)和(L.4.2)。这些混合物特别适合于栽培植物,优选蔬菜、水果、藤本植物、谷物、玉米和豆科作物如大豆的叶处理。

[0412] 包含活性成分的混合物的组合物可以通过常用手段制备,例如通过对于化合物I的组合物所给出的手段。

[0413] 当活的微生物如来自组L1)、L3)和L5)的杀有害生物剂II形成组合物的一部分时,此类组合物可以通过常用手段制备(例如H.D.Burges:Formulation of Microbial Biopesticides[微生物生物杀有害生物剂配制品],施普林格(Springer),1998;WO 2008/002371,US 6,955,912,US 5,422,107)。

[0414] I.合成实例

[0415] 实例1-[6-(二氟甲基)-5-甲基-3-吡啶基]-(3-氟-2-硝基-苯基)甲醇

[0416] 在-78℃下在N_2下,向1-氟-3-碘-2-硝基苯(1440mg,5.3mmol)在THF(2mL)中的溶液中逐滴添加在THF中的PhMgBr溶液(3M)(1.9mL,5.6mmol)。将混合物在-78℃下搅拌1h。然

后在-78℃下在N_2下向混合物中逐滴添加6-(二氟甲基)-5-甲基-吡啶-3-甲醛(600mg,3.5mmol)在THF(10mL)中的溶液,并且将混合物在-78℃下搅拌3h。将混合物用冰水(50mL)淬灭,并且将溶液用EtOAc(15mL×3)萃取。将合并的有机层相继用盐水洗涤、经无水硫酸镁干燥、并真空浓缩以得到呈黄色固体的标题化合物。

[0417] ^{1}H NMR(400MHz,DMSO):μ[ppm]:8.41(d,J=1.5Hz,1H),7.74-7.65(m,2H),7.60-7.51(m,1H),7.48(d,J=7.9Hz,1H),7.16-6.85(m,1H),6.72(d,J=4.8Hz,1H),6.01(d,J=4.6Hz,1H),2.42(s,3H)

[0418] 实例2-(2-氨基-3-氟-苯基)-[6-(二氟甲基)-5-甲基-3-吡啶基]甲醇

[0419] 将[6-(二氟甲基)-5-甲基-3-吡啶基]-(3-氟-2-硝基-苯基)甲醇(550mg,16mmol)和雷尼Ni(110mg)在EtOH(10mL)中的混合物在20℃下在H_2(15PSi)下搅拌1h。将混合物过滤,并且将滤液真空浓缩。将残余物用(PE:EtOAc=10:1)磨碎以得到呈黄色固体的标题化合物。

[0420] ^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$):μ[ppm]:8.44(s,1H),7.60(s,1H),7.01(ddd,J=1.2,8.2,10.7Hz,1H),6.85-6.55(m,3H),5.94(br s,1H),4.15(br s,2H),2.88(br d,J=3.5Hz,1H),2.51(s,3H)

[0421] 实例3-(2-氨基-3-氟-苯基)-[6-(二氟甲基)-5-甲基-3-吡啶基]甲酮

[0422] 在20℃下,向(2-氨基-3-氟-苯基)-[6-(二氟甲基)-5-甲基-3-吡啶基]甲醇(450mg,1.6mmol)在DMF(10mL)中的溶液中添加K_2CO_3(442mg,3.2mmol)和CuCl(31mg,0.32mmol),并且将混合物在65℃下在O_2(15PSi)下搅拌16h。将混合物倒入冰水(30mL)中并过滤。将滤液用EtOAc(30mL×3)萃取、用盐水(15mL)洗涤、经无水硫酸镁干燥、并真空浓缩。将粗产物通过硅胶液相色谱法(PE:EtOAc=5:1)纯化以得到呈黄色油状物的标题化合物。

[0423] ^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$):μ[ppm]:8.65(s,1H),7.85(s,1H),7.23-7.16(m,2H),6.90-6.61(m,1H),6.58(dt,J=4.9,8.0Hz,1H),6.29(br s,2H),2.60(s,3H)

[0424] 实例4-4-[6-(二氟甲基)-5-甲基-3-吡啶基]-8-氟-2,2-二甲基-1H-喹唑啉

[0425] 在65℃下,将(2-氨基-3-氟-苯基)-[6-(二氟甲基)-5-甲基-3-吡啶基]甲酮(200mg,0.7mmol)和NH_4OAc(539mg,7.0mmol)在丙酮(7mL)中的混合物搅拌4h。将混合物倒入冰水(15mL)中,用EtOAc(10mL×3)萃取、用盐水(15mL)洗涤、经无水硫酸镁干燥、并真空浓缩。将粗产物通过硅胶液相色谱法(PE:EtOAc=3:1)纯化以得到呈黄色固体的标题化合物。

[0426] ^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$):μ[ppm]:8.55(s,1H),7.77(s,1H),7.08(ddd,J=1.1,8.2,10.4Hz,1H),6.93-6.52(m,3H),4.25(br s,1H),2.57(s,3H),1.60(s,6H)

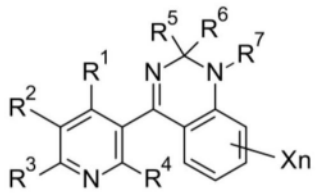
[0427] 表I中列出的化合物以类似的方式制备。

[0428]

表 I：具有式 I 的化合物 Ex-1 至 Ex-7，其中 R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6、R^7 和 Xn 的含义如每一行中所定义。

*HPLC：高效液相色谱法；HPLC-柱 Kinetex XB C18 1.7 μ（50 × 2.1 mm）；洗脱液：乙腈 / 水 +0.1%三氟乙酸（在 60°C 下在 1.5 min 内梯度为 5 : 95 至 100 : 0，在 1.5 min 内流量梯度为 0.8 至 1.0 ml/min）。

R_t：以分钟计的保留时间。

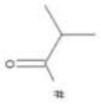


Ex-编号	R^5	R^6	Xn	R^7	R^2	R^3	R^1	R^4	HPLC R_t（min）*	MP（°C）	LS-Nr
Ex-1	CH_3	CH_3	H	H	CH_3	CH_3	H	H			6165237
Ex-2	CH_3	CH_3	H	CH_3	CH_3	CH_3	H	H			6165948

[0429]

Ex-3	CH_3	CH_3	H	$C(O)CH_3$	CH_3	CH_3	H	H		6165958
Ex-4	CH_3	CH_3	H	SO_2-4-CH_3-苯基	CH_3	CH_3	H	H	0.937	161	6179486
EX-5	CH_3	CH_3	8-F	H	CH_3	CHF_2	H	H	0.812	95	6181298
EX-6	CH_3	CH_3	8-F	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	0.872		6182170
EX-7	CH_3	CH_3	8-F	CH_2CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	0.925		6182171
EX-8	CH_3	CH_3	8-Cl	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,895		6182664
EX-9	CH_3	CH_3	8-Cl	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	0,96		6182666
EX-10	CH_3	CH_3	H	H	CH_3	CHF_2	H	H			6183106

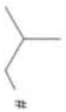
[0430]

EX-11	CH_3	CH_3	8-F	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,097	145,5	6183112
EX-12	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,178	89,4	6183322
EX-13	CH_3	CH_3	8-F	丙基	CH_3	CHF_2	H	H	1,007	94,3	6183323
EX-14	CH_3	CH_3	8-F	丁基	CH_3	CHF_2	H	H	1,068		6183325
EX-15	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,057	70,6	6183327
EX-16	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,293	100,3	6183338
EX-17	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,235	147,3	6183405
EX-18	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,341	130	6183406

[0431]

EX-19	CH_3	CH_3	8-F	异丙基	CH_3	CHF_2	H	H	1,003	95,4	6183408
EX-20	CH_3	CH_3	8-F	乙酰基	CH_3	CHF_2	H	H	1,15	142,5	6183450
EX-21	CH_3	CH_3	H	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H			6183492
EX-22	CH_3	CH_3	8-Cl	CH_3	CH_3	CH_3	H	H			6183519
EX-23	CH_3	CH_3	8-Cl	H	CH_3	CH_3	H	H			6183545
EX-24	CH_3	CH_3	7-F	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,83		6183624
EX-25	CH_3	CH_2CH_3	8-F	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,878		6183625
EX-26	CH_3		8-F	H	CH_3	CHF_2	H	H	1,009		6183626

[0432]

EX-27	CH_3	CH_3	H	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,128	100,5	6186834
EX-28	CH_3	CH_3	8-Cl	CN	CH_3	CH_3	H	H	0,778	182	6186835
EX-29	CH_3	CH_2CH_3	8-F	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	0,946	76	6189246
EX-30	CH_3	CH_2CH_3	8-F	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,209	107	6189262
EX-31	CH_3	CH_3	7-CH_3	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,867	124	6189281
EX-32	CH_3		8-F	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	1,061		6189414
EX-33	CH_3	CH_3	8-Cl	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	1,181	146,5	6189501
EX-34	CH_3	CH_3	8-F	CN	CH_3	CH_3	H	H	0,737	170,5	6190580

[0433]

EX-35	CH_3	CH_3	H	CN	CH_3	CH_3	H	H	0,776	154	6190608
EX-36	CH_3	CH_3	7-F	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	0,863	93	6190649
EX-37	CH_3	CH_3	7-Cl	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,889	130	6190651
EX-38	CH_3	CH_3	7-Cl	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	0,946	85	6190652
EX-39	CH_3	CH_3	7-Cl	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,276	145	6190653
EX-40	CH_3	CH_3	$7\text{-}CH_3$	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	0,889	85	6190654
EX-41	CH_3		8-F	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,327	113	6190655
EX-42	CH_3		8-F	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,912	98	6190656

[0434]

EX-43	CH_3	苯基	8-F	H	CH_3	CHF_2	H	H	1,045	111	6190657
EX-44	CH_3	2-吡啶	8-F	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,949	126	6190658
EX-45	CH_3	CH_3	H	丁基	CH_3	CH_3	H	H	0,848		6190948
EX-46	CH_3	CH_3	H	丙基	CH_3	CH_3	H	H	0,783		6190949
EX-47	CH_3	CH_3	H	CH_2CH_3	CH_3	CH_3	H	H	0,72		6190950
EX-48	CH_3	CH_3	8-F	H	CH_3	CH_3	H	H	0,662		6190957
EX-49	CH_3	CH_3	8-Br	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,944		6191147
EX-50	CH_3	CH_3	8-Br	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	1,005		6191148

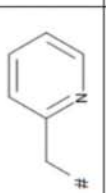
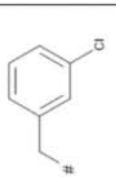
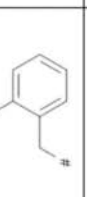
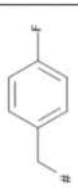
[0435]

EX-51	CH_3	CH_3	8-Br	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,194	150	6191149
EX-52	CH_3	CH_3	8-CH_3	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,866	121	6191150
EX-53	CH_3	CH_3	8-CH_3	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	0,901		6191151
EX-54	CH_3	CH_3	8-CH_3	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,183	144	6191152
EX-55	CH_3	CH_3	7-F	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,209	143	6191153
EX-56	CH_3		8-F	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	1,057	95	6191154
EX-57	CH_3		8-F	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,249	140	6191155
EX-58	CH_3	CH_2-O-CH_3	8-F	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,909	108	6191156

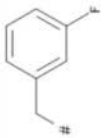
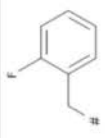
[0436]

EX-59	CH_3	CH_2-O-CH_3	8-F	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	0,966	6191159
EX-60	CH_3	苯基	8-F	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	1,134	147	6191160
EX-61	CH_3	2-吡啶基	8-F	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	0,922	166	6191162
EX-62	CH_3	CH_3	H	苄基	CH_3	CH_3	H	H	0,91		6191655
EX-63	CH_3	CH_3	8-F	苄基	CH_3	CH_3	H	H	0,949		6191656
EX-64	CH_3	CH_3	8-F	丁基	CH_3	CH_3	H	H	0,95		6192431
EX-65	CH_3	CH_3	8-F	CH_2CH_3	CH_3	CH_3	H	H	0,83	115	6192432
EX-66	CH_3	CH_3	8-F	CH_3	CH_3	CH_3	H	H	0,785	101	6192434

[0437]

EX-67	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CH_3	H	H	0,663		6192838
EX-68	CH_3	CH_3	H		CH_3	CH_3	H	H	0,874		6192839
EX-69	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CH_3	H	H	0,916		6192840
EX-70	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	0,866		6195603
EX-71	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,174		6195604
EX-72	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,185		6195605
EX-73	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,195	149	6195606
EX-74	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,108	113	6195607

[0438]

EX-75	CH_3	CH_3	’8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,126		6195608
EX-76	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,11	91	6195609
EX-77	CH_3	CH_3	8-F	苄基	CH_3	CHF_2	H	H	1,08	88	6195610
EX-78	CH_3	苯基	8-F	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,268	198	6195614
EX-79	CH_3	CH_2-O-CH_3	8-F	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,13	117	6195615
EX-80	CH_3	CH_3	8-炔丙基	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	0,957	91	6195616
EX-81	CH_3	CH_3	8-乙炔基	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,916	115	6195617
EX-82	CH_3	CH_3	8-CN	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,939	152	6195618

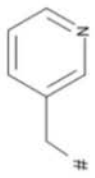
[0439]

EX-83	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CH_3	H	0,907	89	6201291
EX-84	CH_3	CH_3	H		CH_3	CH_3	H	0,844		6201292
EX-85	CH_3	CH_3	8-CN	CH_3	CH_3	CHF_2	H	0,951	89	6201293
EX-86	CH_3	CH_3	8-CN	CN	CH_3	CHF_2	H	1,081	168	6201294
EX-87	CH_3	CH_3	8-乙炔基	H	CH_3	CHF_2	H	0,896		6201295
EX-88	CH_3	CH_3		H	CH_3	CHF_2	H	1,186		6201296
EX-89	CH_3	CH_3	7-CH_3	CN	CH_3	CHF_2	H	1,23	105	6201297
EX-90	CH_3	CH_3	7,8-F_2	H	CH_3	CHF_2	H	0,877	118	6201298

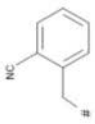
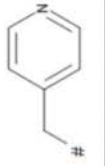
[0440]

EX-91	CH_3	CH_3	7,8-F_2	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	0,944	79	6201299
EX-92	CH_3	CH_3	7-Br,8-CH_3	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,969	112	6201300
EX-93	CH_3	CH_3	7-Br,8-CH_3	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	1,017	152	6201301
EX-94	CH_3	CH_3	7-Br,8-CH_3	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,29	158	6201302
EX-95	CH_3	2-吡啶	8-F	CN	CH_3	CHF_2	H	H	0,82	208	6201303
EX-96	CH_3		8-F	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,947		6201304
EX-97	CH_3	CH_3	8-F	CH_2CH_2F	CH_3	CHF_2	H	H	0,919	105	6201317
EX-98	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,066	148	6201318

[0441]

EX-99	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,061	139	6201319
EX-100	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	0,794		6201320
EX-101	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	0,983	81	6201321
EX-102	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	0,959		6201322
EX-103	CH_3	CH_3	8-F	丙基	CH_3	CH_3	H	H	0,893	85	6201345
EX-104	CH_3	CH_3	H		CH_3	CH_3	H	H	0,782		6201352
EX-105	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CH_3	H	H	0,897		6201359
EX-106	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CH_3	H	H	0,833	123,5	6205333

[0442]

EX-107	CH_3	CH_3	H		CH_3	CH_3	H	H	0,79	122,5	6205443
EX-108	CH_3	CH_3	乙炔基	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,136	186	6205604
EX-109	CH_3	CH_2CH_2Cl	8-F	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,733	147	6205606
EX-110	CH_3	苄基	8-F	H	CH_3	CHF_2	H	H	1,049	147	6205607
EX-111	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,058	139	6205612
EX-112	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	0,772	130	6205613
EX-113	CH_3	CH_3	8-F	$CH_2CH_2OCH_3$	CH_3	CH_3	H	H	0,812		6206774
EX-114	CH_3	CH_3	H		CH_3	CH_3	H	H	0,844		6206775

[0443]

EX-115	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CH_3	H	0,871	131,5	6206776
EX-116	CH_3	CH_3	8-F	CH_2CHF_2	CH_3	CHF_2	H	1,007	95,1	6207722
EX-117	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	1,074	111,9	6207737
EX-118	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	0,992	115,2	6207797
EX-119	CH_3	CH_3	8-F	新戊基	CH_3	CHF_2	H	1,074	115,7	6207838
EX-120	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	1,067	105	6207840
EX-121	CH_3		8-F	CH_3	CH_3	CHF_2	H	0,981	66	6207895
EX-122	CH_3	苄基	8-F	CN	CH_3	CHF_2	H	1,276	90,5	6207897

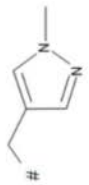
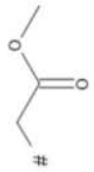
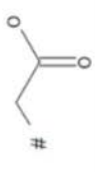
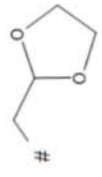
[0444]

EX-123	CH_3	苄基	8-F	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	1,098	6207937
EX-124	CH_3		8-F	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,766	165,4	6208229
EX-125	CH_3	CH_3	7,8-$(CH_3)_2$	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,237	132,1	6208387
EX-126	CH_3	CH_3	8-炔丙基	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,276	171,1	6208388
EX-127	CH_3	CH_3	7-Cl,8-F	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,982	128	6208389
EX-128	CH_3	CH_3	7-CH_3,8-F	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,878	116,1	6208403
EX-129	CH_3	CH_3	7-Br,8-F	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,999	133,1	6208441
EX-130	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	0,993		6209318

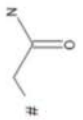
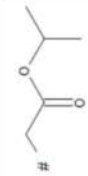
[0445]

EX-131	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	0,934	103,5	6209319
EX-132	CH_3	CH_3	8-F	$CH_2CH_2OCH_3$	CH_3	CHF_2	H	0,912		6209320
EX-133	CH_3	CH_3	7-OCH_3,8-F	H	CH_3	CHF_2	H	0,829	154	6209660
EX-134	CH_3	CH_3	7-OCH_3,8-F	CH_3	CH_3	CHF_2	H	0,875	143	6209661
EX-135	CH_3	CH_3	7-OCH_3,8-F	CN	CH_3	CHF_2	H	1,153	200	6209662
EX-136	CH_3	CH_3	7,8-$(CH_3)_2$	H	CH_3	CHF_2	H	0,814	118	6209663
EX-137	CH_3	CH_3	7,8-$(CH_3)_2$	CH_3	CH_3	CHF_2	H	0,947	127	6209664
EX-138	CH_3	CH_2CN	8-F	H	CH_3	CHF_2	H	1,063	125	6209665

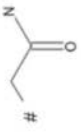
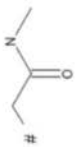
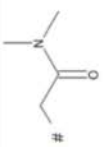
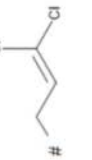
[0446]

EX-139	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,139	104	6209673
EX-140	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	0,883	129	6209674
EX-141	CH_3	CH_3	8-F	CH_2CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,059	139	6210165
EX-142	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	0,925	88	6210166
EX-143	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	0,817	152	6210167
EX-144	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	0,902	118	6210168
EX-145	CH_3	CH_3	7-Cl,8-F	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	1,052	149	6210671
EX-146	CH_3	CH_3	7-Cl,8-F	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,228	193	6210672

[0447]

EX-147	CH_3	CH_3	7-CH_3,8-F	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	0,912	142	6210673
EX-148	CH_3	CH_3	7-CH_3,8-F	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,201	134	6210674
EX-149	CH_3	CH_2CN	8-F	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	1,113	148	6210676
EX-150	CH_3	$CH_2CH_2CCl_3$	8-F	H	CH_3	CHF_2	H	H	1,266	148	6210677
EX-151	CH_3		8-F	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	0,78	107	6210679
EX-152	CH_3	CH_3	7,8-F_2	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,184	150,6	6211605
EX-153	CH_3	CH_3	8-CHF_2	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,902	87,1	6211606
EX-154	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,033	82	6211626

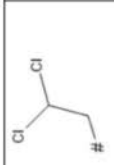
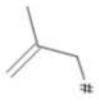
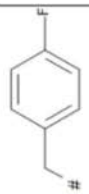
[0448]

EX-155	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	0,753	182	6211627
EX-156	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	0,786		6211628
EX-157	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	0,815		6211629
EX-158	CH_3	CH_3	8-CHF_2	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	0,983	89	6211869
EX-159	CH_3	CH_3	8-CHF_2	CN	CH_3	CHF_2	H	H	1,178	90	6211870
EX-160	CH_3	CH_3	8-F	CH_2CH_2Cl	CH_3	CHF_2	H	H	1,013	124	6211871
EX-161	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,211	96	6211873
EX-162	CH_3	CH_3	8-F	苯基	CH_3	CHF_2	H	H	1,114	115	6212558

[0449]

EX-163	CH_3	CH_3	8-F	H	$(CH_2)_4$	CH_3	H	H	0,753	145	6212564
EX-164	CH_3	CH_3	8-F	CH_3	$(CH_2)_4$	CH_3	H	H	0,817		6212565
EX-165	CH_3	CH_3	8-F	CN	$(CH_2)_4$	CH_3	H	H	0,815	148	6212566
EX-166	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CH_3	H	H	0,914	115,6	6215047
EX-167	CH_3	CH_3	H		CH_3	CH_3	H	H	0,852		6215048
EX-168	CH_3	CH_3	H		CH_3	CHF_2	H	H	0,94		6215049
EX-169	CH_3	CH_3	7-F,8-Cl	H	CH_3	CHF_2	H	H	0,943	130	6215513
EX-170	CH_3	CH_3	7-F,8-Cl	CH_3	CH_3	CHF_2	H	H	1,01	123	6215514

[0450]

EX-171	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,18	113	6215515
EX-172	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	0,934	133	6215516
EX-173	CH_3	CH_3	8-F	H	CH_3	CN	H	H	0,813	193	6215517
EX-174	CH_3	CH_3	8-F		CH_3	CHF_2	H	H	1,038		6215584
EX-175	CH_3	CH_3	H	苄基	CH_3	CHF_2	H	H	1,005	123	6215846
EX-176	CH_3	CH_3	H		CH_3	CHF_2	H	H	1,016		6215847
EX-177	CH_3	CH_3	H	苯基	CH_3	CHF_2	H	H	1,000	102	6215848
EX-178	CH_3	CH_3	8-F	CH_3	CH_3	CN	H	H	0,919	128	6215849

[0451]

EX-179	CH_3	CH_3	8-F	CN	CH_3	CN	H	H	1,092	163	6215850
EX-180	CH_3	CH_3	7,8-F_2	CH_3	CH_3	CH_3	H	H	0,759	178	6215852
EX-181	CH_3	CH_3	7,8-F_2	H	CH_3	CH_3	H	H	0,830	106	6215853
EX-182	CH_3	CH_3	H		CH_3	CHF_2	H	H	0,908		6216168
EX-183	CH_3	CH_3	7,8-F_2	CN	CH_3	CH_3	H	H	0,812	150,6	6216222
EX-184	CH_3	CH_3	8-F	CN	CH_3	乙炔基	H	H	1,046	134,2	6216226
EX-185	CH_3	CH_3	8-F	CH_3	CH_3	乙炔基	H	H	0,858	99,5	6216227
EX-186	CH_3	CH_3	8-F	H	CH_3	乙炔基	H	H	0,801	103,9	6216253

[0452] 温室

[0453] 将化合物溶解在溶剂-乳化剂之比(体积)为99:1的丙酮和/或二甲亚砜和基于乙

氧基化烷基酚的润湿剂/乳化剂Wettol的混合物中以得到5ml的总体积。随后,添加水至100ml的总体积。

[0454] 然后将此储备溶液用所述溶剂-乳化剂-水混合物稀释至下表中给出的最终浓度。

[0455] 实例1-青椒叶上的灰葡萄孢菌的预防性杀真菌控制

[0456] 青椒幼苗在盆中生长至4至5叶阶段。用前述喷雾溶液喷雾这些植物至滴流(run-off),该喷雾溶液含有下表中所提及的浓度的活性成分或混合物。第二天,用含灰葡萄孢菌孢子悬浮液的生物麦芽水溶液或DOB溶液接种植物。然后立即将植物转移至潮湿室。在22℃至24℃和饱和相对湿度下5天后,目视评估叶子上真菌侵袭的程度,作为%病叶面积。

[0457] 在此测试中,经250ppm分别来自Ex-2、Ex-6、Ex-7、Ex-9、Ex-11、Ex-13、Ex-14、Ex-15、Ex-19、Ex-21、Ex-22、Ex-23、Ex-27、Ex-28、Ex-29、Ex-30、Ex-32、Ex-33、Ex-34、Ex-35、Ex-36、Ex-38、Ex-39、Ex-40、Ex-41、Ex-43、Ex-45、Ex-46、Ex-53、Ex-54、Ex-55、Ex-56、Ex-60、Ex-61、Ex-62、Ex-63、Ex-89、Ex-107、Ex-115、Ex-116、Ex-125、Ex-130、Ex-134、Ex-141、Ex-142、Ex-144、Ex-145、Ex-146、Ex-147、Ex-148、Ex-149、Ex-152、Ex-158、Ex-161、实例164、Ex-165、Ex-167的实例的活性物质处理的样品显示出最高达至多15%的病原体增长率,而未处理的植物80%被感染。

[0458] 实例2-由核盘菌(Slerotinia sclerotiorum)SCLESC P1 OSR引起的油菜上白霉的预防性杀真菌控制

[0459] 油菜在盆中生长至13至14叶阶段。用前述喷雾溶液喷雾这些植物至滴流(run-off),该喷雾溶液含有下表中所提及的浓度的活性成分或其混合物。

[0460] 植物可以风干。第二天,用25μl的2.5%甲基纤维素将施药后的油菜花瓣固定在叶1上,并将2.25μl的核盘菌孢子悬浮液用移液管移至每个固定好的油菜花瓣上。在20℃和60%的相对湿度下14天后,目视评估叶子上真菌侵袭的程度,作为%病叶面积。

[0461] 在此测试中,经100g/ha分别来自Ex-6、Ex-9、Ex-19、Ex-22、Ex-27、Ex-30、Ex-32、Ex-33、Ex-45、Ex-53、Ex-60、Ex-80、Ex-81的实例的活性物质处理的样品显示出最高达至多13%的病原体增长率,而未处理的植物80%被感染。

[0462] 实例3-由核盘菌(SCLESC P1)引起的大豆上白霉的预防性杀真菌控制

[0463] 将大豆幼苗种植在盆中。用前述喷雾溶液喷雾这些植物至滴流,该喷雾溶液含有下表中所提及的浓度的活性成分或混合物。第二天,用含核盘菌菌丝的生物麦芽悬浮液接种经处理的植物。然后,将试验植物在23℃且相对湿度在80%与85%之间的温室中培育6天。目视评估叶子上真菌侵袭的程度,作为%病叶面积。

[0464] 在此测试中,经250ppm分别来自Ex-6、Ex-7、Ex-9、Ex-13、Ex-14、Ex-15、Ex-19、Ex-27、Ex-29、Ex-32、Ex-33、Ex-45、Ex-53、Ex-60、Ex-80、Ex-81、Ex-91、Ex-116、Ex-134、Ex-141、Ex-158、Ex-170的实例的活性物质处理的样品显示出最高达至多21%的病原体增长率,而未处理的植物80%被感染。

[0465] 微测试

[0466] 将活性化合物单独配制为在二甲亚砜中的浓度为10000ppm的储备溶液。

[0467] 按比例混合储备溶液,将其用移液管移到微量滴定板(MTP)上并用水稀释至规定浓度。

[0468] 实例1-微量滴定板测试中的抗灰霉灰葡萄孢菌活性

[0469] 然后添加灰葡萄孢菌(Botrci cinerea)在生物麦芽水溶液或酵母-细菌蛋白胨-乙酸钠溶液中的孢子悬浮液。

[0470] 在此测试中,经31ppm分别来自实例Ex-1、Ex-2、Ex-3、Ex-4、Ex-5、Ex-6、Ex-7、Ex-8、Ex-9、Ex-11、Ex-13、Ex-14、Ex-15、Ex-16、Ex-17、Ex-19、Ex-20、Ex-21、Ex-22、Ex-23、Ex-24、Ex-25、Ex-26、Ex-27、Ex-28、Ex-29、Ex-30、Ex-31、Ex-32、Ex-33、Ex-34、Ex-35、Ex-36、Ex-37、Ex-38、Ex-39、Ex-40、Ex-41、Ex-42、Ex-43、Ex-44、Ex-45、Ex-46、Ex-47、Ex-48、Ex-49、Ex-50、Ex-51、Ex-52、Ex-53、Ex-54、Ex-55、Ex-56、Ex-57、Ex-58、Ex-59、Ex-60、Ex-61、Ex-62、Ex-63、Ex-64、Ex-65、Ex-66、Ex-67、Ex-68、Ex-69、Ex-70、Ex-71、Ex-72、Ex-73、Ex-74、Ex-75、Ex-76、Ex-77、Ex-79、Ex-80、Ex-81、Ex-83、Ex-84、Ex-84、Ex-85、Ex-86、Ex-87、Ex-88、Ex-89、Ex-90、Ex-91、Ex-92、Ex-93、Ex-94、Ex-95、Ex-96、Ex-97、Ex-98、Ex-99、Ex-100、Ex-1β1、Ex-102、Ex-103、Ex-104、Ex-105、Ex-106、Ex-107、Ex-109、Ex-110、Ex-111、Ex-112、Ex-113、Ex-114、Ex-115、Ex-116、Ex-117、Ex-118、Ex-119、Ex-120、Ex-121、Ex-122、Ex-123、Ex-125、Ex-127、Ex-128、Ex-129、Ex-130、Ex-131、Ex-132、Ex-133、Ex-134、Ex-135、Ex-136、Ex-137、Ex-139、Ex-141、Ex-142、Ex-143、Ex-144、Ex-145、Ex-146、Ex-147、Ex-148、Ex-149、Ex-150、Ex-151、Ex-152、Ex-153、Ex-154、Ex-157、Ex-158、Ex-159、Ex-160、Ex-161、Ex-162、Ex-163、Ex-164、Ex-165、Ex-166、Ex-167、Ex-168、Ex-169、Ex-170、Ex-171、Ex-172的活性物质处理的样品显示出最高达14%的病原体增长率。

[0471] 实例2-微量滴定板测试中的抗黄色镰孢菌活性

[0472] 然后添加黄色镰孢菌在生物麦芽水溶液或酵母-细菌蛋白胨-甘油或DOB溶液中的孢子悬浮液。

[0473] 在此测试中,经31ppm分别来自实例Ex-2、Ex-3、Ex-4、Ex-6、Ex-9、Ex-13、Ex-16、Ex-19、Ex-20、Ex-22、Ex-23、Ex-27、Ex-29、Ex-32、Ex-33、Ex-34、Ex-35、Ex-36、Ex-38、Ex-40、Ex-46、Ex-47、Ex-50、Ex-53、Ex-55、Ex-59、Ex-60、Ex-63、Ex-65、Ex-66、Ex-67、Ex-75、Ex-77、Ex-81、Ex-89、Ex-91、Ex-93、Ex-101、Ex-102、Ex-103、Ex-104、Ex-105、Ex-106、Ex-107、Ex-114、Ex-117、Ex-121、Ex-122、Ex-123、Ex-125、Ex-132、Ex-134、Ex-135、Ex-137、Ex-145、Ex-147、Ex-148、Ex-149、Ex-151、Ex-160、Ex-164、Ex-165、Ex-166、Ex-167、Ex-170、Ex-172的活性物质处理的样品显示出最高达20%的病原体增长率。

[0474] 实例3-抗小麦壳针孢引起的小麦上叶疱病的活性

[0475] 然后添加小麦壳针孢在生物麦芽水溶液或酵母-细菌蛋白胨-甘油或DOB溶液中的孢子悬浮液。

[0476] 在此测试中,经31ppm分别来自实例Ex-3、Ex-9、Ex-14、Ex-19、Ex-22、Ex-29、Ex-32、Ex-38、Ex-50、Ex-53、Ex-56、Ex-62、Ex-63、Ex-64、Ex-65、Ex-66、Ex-68、Ex-69、Ex-70、Ex-71、Ex-73、Ex-74、Ex-75、Ex-76、Ex-77、Ex-81、Ex-87、Ex-91、Ex-92、Ex-93、Ex-94、Ex-97、Ex-101、Ex-102、Ex-103、Ex-105、Ex-106、Ex-113、Ex-115、Ex-118、Ex-123、Ex-125、Ex-127、Ex-129、Ex-130、Ex-132、Ex-137、Ex-141、Ex-142、Ex-145、Ex-147、Ex-158、Ex-161、Ex-164、Ex-165、Ex-166、Ex-167、Ex-168、Ex-169、Ex-170的活性物质处理的样品显示出最高达20%的病原体增长率。

[0477] 将测量的参数与无活性化合物的对照变体的增长率(100%)和无真菌的空白值进行比较,以确定相应活性化合物中病原体的相对增长率(以%计)。

[0478] 实例4-微量滴定板测试中的抗灰霉稻瘟霉活性

[0479] 然后添加稻瘟霉在生物麦芽水溶液或酵母-细菌蛋白胨-乙酸钠溶液中的孢子悬浮液。

[0480] 在此测试中,经31ppm分别来自实例Ex-1、Ex-2、Ex-3、Ex-4、Ex-5、Ex-6、Ex-7、Ex-8、Ex-9、Ex-13、Ex-14、Ex-16、Ex-19、Ex-21、Ex-22、Ex-23、Ex-25、Ex-26、Ex-27、Ex-28、Ex-29、Ex-30、Ex-31、Ex-33、Ex-36、Ex-37、Ex-38、Ex-40、Ex-41、Ex-42、Ex-44的活性物质处理的样品显示出最高达20%的病原体增长率。

[0481] 实例5-微量滴定板测试中的抗灰霉甜菜生尾孢(Cercospora beticula)活性

[0482] 然后添加甜菜生尾孢在生物麦芽水溶液或酵母-细菌蛋白胨-乙酸钠溶液中的孢子悬浮液。

[0483] 在此测试中,经31ppm分别来自实例Ex-9、Ex-22、Ex-32、Ex-50、Ex-53、Ex-56、Ex-60的活性物质处理的样品显示出最高达17%的病原体增长率。

[0484] 实例6-微量滴定板测试中的抗灰霉大豆尾孢活性

[0485] 然后添加大豆尾孢在生物麦芽水溶液或酵母-细菌蛋白胨-乙酸钠溶液中的孢子悬浮液。

[0486] 在此测试中,经31ppm分别来自实例Ex-6、Ex-9、Ex-22、Ex-23、Ex-28、Ex-29、Ex-32的活性物质处理的样品显示出最高达17%的病原体增长率。

[0487] 实例7-微量滴定板测试中的抗灰霉玉蜀黍尾孢菌活性

[0488] 然后添加玉蜀黍尾孢菌在生物麦芽水溶液或酵母-细菌蛋白胨-乙酸钠溶液中的孢子悬浮液。

[0489] 在此测试中,经31ppm分别来自实例Ex-5、Ex-6、Ex-9、Ex-22、Ex-29、Ex-38、Ex-41、Ex-50、Ex-53、Ex-56、Ex-60、Ex-61、Ex-81、Ex-91的活性物质处理的样品显示出17%的病原体增长率。

[0490] 实例8-微量滴定板测试中的抗灰霉山扁豆生棒孢菌(Corynespora cassiicola)G413A突变体活性

[0491] 然后添加山扁豆生棒孢菌在生物麦芽水溶液或酵母-细菌蛋白胨-乙酸钠溶液中的孢子悬浮液。

[0492] 在此测试中,经31ppm分别来自实例Ex-5、Ex-6、Ex-7、Ex-8、Ex-9、Ex-13、Ex-14、Ex-15、Ex-20、Ex-22、Ex-23、Ex-25、Ex-26、Ex-27、Ex-28、Ex-29、Ex-31、Ex-32、Ex-35、Ex-36、Ex-38、Ex-40、Ex-41、Ex-50、Ex-53、Ex-55、Ex-56、Ex-60、Ex-61、Ex-91的活性物质处理的样品显示出19%的病原体增长率。