



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 103298802 B

(45) 授权公告日 2016. 06. 08

(21) 申请号 201180052855. 3

C07D 403/12(2006. 01)

(22) 申请日 2011. 11. 02

C07D 405/12(2006. 01)

(30) 优先权数据

C07D 409/12(2006. 01)

10356030. 6 2010. 11. 02 EP

C07D 413/12(2006. 01)

61/472, 374 2011. 04. 06 US

C07D 417/12(2006. 01)

A01N 43/56(2006. 01)

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

A01N 43/647(2006. 01)

2013. 05. 02

A01N 43/74(2006. 01)

(86) PCT国际申请的申请数据

A01N 43/78(2006. 01)

PCT/EP2011/069206 2011. 11. 02

A01N 43/828(2006. 01)

(87) PCT国际申请的公布数据

A01N 43/832(2006. 01)

W02012/059497 EN 2012. 05. 10

A01N 43/836(2006. 01)

(73) 专利权人 拜耳知识产权有限责任公司

(56) 对比文件

地址 德国蒙海姆

W0 2009016222 A1, 2009. 02. 05,

W0 2010130767 A2, 2010. 11. 18,

(72) 发明人 J·本汀 P·克里斯涛 P·达曼

审查员 刘广宇

P·德斯伯德斯 S·加里

J-P·施密特 U·沃彻多夫-纽曼

(74) 专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司

公司 11285

代理人 苏萌 钟守期

(51) Int. Cl.

C07D 401/12(2006. 01)

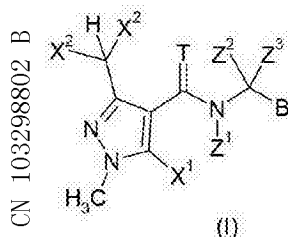
权利要求书2页 说明书58页

(54) 发明名称

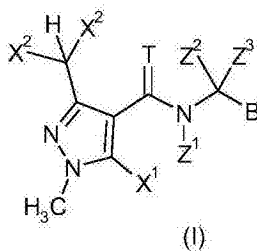
N-杂芳基甲基吡啶基羧酰胺

(57) 摘要

本发明涉及N-杂芳基甲基吡啶基羧酰胺衍生物或其硫代羧酰胺衍生物、其制备方法、其作为杀真菌剂的用途(特别是以组合物的形式)。通式(I), 以及使用这些化合物或组合物来控制(特别是植物的)植物病原真菌的方法。



1. 一种通式(I)的化合物, 及其盐、以及光学活性异构体或几何异构体:



式中:

- T表示O或S;
- X^1 和 X^2 可以相同或不同, 表示氯或氟原子;
- Z^1 表示氢原子、未取代的 C_1-C_8 -烷基、或未取代的 C_3-C_7 -环烷基;
- Z^2 和 Z^3 可以相同或不同, 表示氢原子; 被卤原子取代或未取代的 C_1-C_8 -烷基; 或者
- Z^2 和 Z^3 与它们所连接的碳原子一起形成未取代的 C_3-C_7 环烷基;
- B表示饱和或不饱和的包含1至最多4个选自N、O和S的杂原子的单环或稠合双环5-、6-、9-、10-元环, 该环最多可被6个可相同或不同的基团X取代; 前提条件是B不是2-吡啶环, 以及当 Z^1 表示未取代的环丙基时, B不是1,3-苯并间二氧杂环戊烯基环;
- X表示卤原子; 未取代的 C_1-C_8 -烷基; 具有1-5个卤原子的 C_1-C_8 -卤代烷基; 未取代的 C_1-C_8 -烷氧基; 具有1-5个卤原子的 C_1-C_8 -卤代烷氧基; 未取代的 C_1-C_8 -烷基硫烷基; 最多可被6个可相同或不同的基团Q取代的苯基; 或者
- Z^3 和与B基团的连接点相邻的取代基X、以及它们所连接的连续碳原子一起可形成被 C_1-C_8 -烷基取代或未取代的6元部分饱和的碳环; Z^2 表示氢原子、或者被卤原子取代或未取代的 C_1-C_8 -烷基;
- Q独立地表示卤原子。

2. 如权利要求1所述的化合物, 其特征在于, Z^1 表示未取代的环丙基、氢原子、甲基或乙基。

3. 如权利要求1或2所述的化合物, 其特征在于, T表示O。

4. 如权利要求1或2所述的化合物, 其特征在于, X^1 表示氟原子。

5. 如权利要求1或2所述的化合物, 其特征在于, X^2 表示氟原子。

6. 如权利要求1或2所述的化合物, 其特征在于, Z^2 和 Z^3 独立地表示氢原子或甲基。

7. 如权利要求1或2所述的化合物, 其特征在于, Z^2 表示氢原子, Z^3 表示氢原子或甲基。

8. 如权利要求1或2所述的化合物, 其特征在于, B表示被X取代或未取代的噻吩环、被X取代或未取代的苯并噻吩环、被X取代或未取代的喹啉环、被X取代或未取代的异喹啉环、或被X取代或未取代的苯并呋喃环,

其中, X表示卤原子; 未取代的 C_1-C_8 -烷基; 具有1-5个卤原子的 C_1-C_8 -卤代烷基; 未取代的 C_1-C_8 -烷氧基; 具有1-5个卤原子的 C_1-C_8 -卤代烷氧基; 未取代的 C_1-C_8 -烷基硫烷基; 或者最多可被6个可相同或不同的基团Q取代的苯基; 以及

其中, Q表示卤原子。

9. 如权利要求1或2所述的化合物, 其特征在于, B表示被X取代或未取代的噻吩环,

其中, X表示卤原子; 未取代的 C_1-C_8 -烷基; 具有1-5个卤原子的 C_1-C_8 -卤代烷基; 未取代

的C₁-C₈-烷氧基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷氧基;未取代的C₁-C₈-烷基硫烷基;或者最多可被6个可相同或不同的基团Q取代的苯基;以及

其中,Q表示卤原子。

10.如权利要求1或2所述的化合物,其特征在于,B表示被X取代或未取代的苯并噻吩环,

其中,X表示卤原子;未取代的C₁-C₈-烷基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷基;未取代的C₁-C₈-烷氧基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷氧基;未取代的C₁-C₈-烷基硫烷基;或者最多可被6个可相同或不同的基团Q取代的苯基;以及

其中,Q表示卤原子。

11.如权利要求1或2所述的化合物,其特征在于,X独立地表示卤原子;未取代的C₁-C₈-烷基;最多含9个可相同或不同的卤原子的C₁-C₈-卤代烷基;未取代的C₁-C₈-烷氧基或最多含9个可相同或不同的卤原子的C₁-C₈-卤代烷氧基。

12.一种杀真菌剂组合物,其包含有效量的作为活性成分的如权利要求1-11中任一项所述的通式(I)的化合物和农学上可接受的担体、载体或填料。

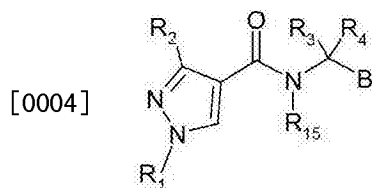
13.一种控制作物的植物病原真菌的方法,其特征在于,将农业有效且基本上无植物毒性量的如权利要求1至11中任一项所述的化合物或者如权利要求12所述的杀真菌剂组合物施用到植物生长或者能够生长的土壤,施用到植物叶子和/或植物果实上,或者施用到植物种子上。

N-杂芳基甲基吡唑基羧酰胺

[0001] 说明书

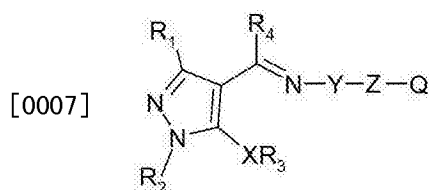
[0002] 本发明涉及N-杂芳基甲基吡唑基羧酰胺衍生物或其硫代羧酰胺衍生物、其制备方法、其作为杀真菌剂的用途(特别是以组合物的形式),以及使用这些化合物或组合物来控制(特别是植物的)植物病原真菌的方法。

[0003] 在国际专利申请W0-2009/024342中,某些杀真菌吡唑-4-羧酸酰胺广义地概括为以下通式表示的多种化合物:



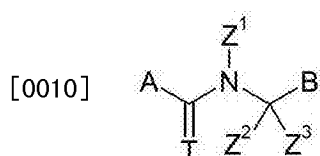
[0005] 式中, R_1 可表示烷基; R_2 可表示卤代烷基; R_{15} 可表示氢原子或环丙基; R_3 或 R_4 可表示各种取代基, 包括烷基、卤代烷基等; B 可表示5至10元单环或含1-3个杂原子的稠合杂芳环体系。但是, 该文献没有揭示或建议其中吡唑基的5位取代基可表示卤原子的任何此类衍生物。另外, 该文献没有揭示或建议包括与羧酰胺残基的氮原子连接的烷基、烷氧基或 C_4 - C_7 -环烷基的任何化合物。

[0006] 在专利申请CN1188764中, 某些杀真菌吡唑衍生物广义地概括为以下通式表示的多种化合物:



[0008] 式中, R_1 或 R_2 可表示烷基或卤代烷基; X 可表示直接键; R_3 可表示各种取代基, 包括氯原子; R_4 可表示各种取代基, 包括氧原子或硫原子; Y 和 Z 可表示直接键; Q 可表示各种基团, 包括取代的苄基。但是, 该文献没有揭示或建议包括与羧酰胺残基的氮原子连接的烷基、烷氧基或环烷基的任何化合物。另外, 该文献没有明确地揭示或建议以选择其中吡唑基可表示1-甲基-3-(二氟或二氯)甲基-5-(氯或氟)-4-吡唑基的任何此类衍生物。

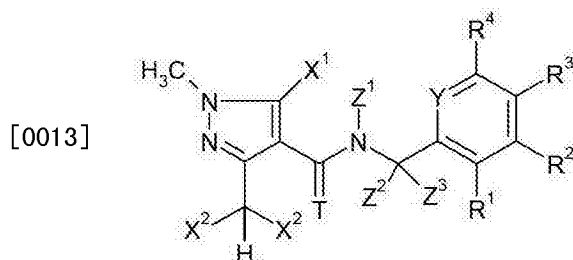
[0009] 在国际专利申请W0-2008/015189、W0-2008/037789、W0-2009/016221和W0-2009/016222中, 某些酰胺衍生物广义地概括为以下通式表示的多种化合物:



[0011] 式中, A 可表示与碳连接的部分饱和或不饱和的5元杂环基, 该基团可被取代; Z 可表示(未)取代的环烷基; B 可表示各种单环或稠合的5-和6-元杂芳环。但是, 该文献没有揭示或建议具有与羧酰胺残基的氮原子连接的氢原子、烷基或烷氧基的任何化合物。另外, 该文献没有明确地揭示或建议以选择其中 A 可表示1-甲基-3-(二氟或二氯)甲基-5-(氯或

氟)-4-吡唑基的任何此类衍生物。

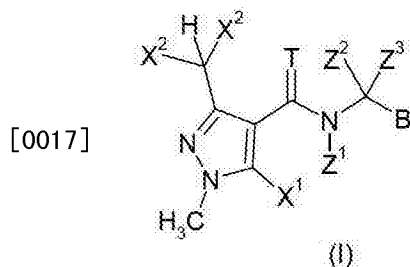
[0012] 在国际专利申请WO-2010/130767中,某些酰胺衍生物广义地概括为以下通式表示的多种化合物:



[0014] 式中, X^1 和 X^2 可表示氯或氟原子; T 可表示O或S; Z^1 可表示(未)取代的环丙基; Z^2 和 Z^3 可为氢、烷基等; Y 可表示N或CHR⁵; R^1 至 R^5 可表示各种取代基,并且两个相邻的取代基R与它们所连接的连续碳原子一起可形成(未)取代的5-或6-元饱和的碳环或最多包含3个杂原子的杂环。但是,该文献没有揭示或建议具有与羧酰胺残基的氮原子连接的氢原子、烷基或烷氧基的任何化合物。另外,该文献没有揭示或建议以选择其中苯环或2-吡啶环可被另一种不饱和的单环或稠合双环杂芳环代替的任何此类衍生物。

[0015] 在农业领域中人们一直高度关注新杀虫剂化合物的应用,以避免或防控对活性成份有耐药性的菌株的产生。同样人们高度关注使用比已知化合物活性更高的新颖化合物,目标在于降低所使用的活性化合物的量,与此同时维持至少与已知化合物相当的效力。本发明人现已发现拥有上述效果和优点的一类新化合物。

[0016] 因此,本发明提供了通式(I)的衍生物,及其盐、N-氧化物、金属配合物、类金属配合物(metalloid complexes)以及光学活性异构体或几何异构体:



[0018] 式中:

[0019] • T 表示O或S;

[0020] • X^1 和 X^2 可以相同或不同,表示氯或氟原子;

[0021] • • Z^1 表示氢原子、取代或未取代的C₁-C₈-烷基、取代或未取代的C₁-C₈-烷氧基、取代或未取代的C₂-C₈-烯基、取代或未取代的C₂-C₈-炔基、取代或未取代的C₃-C₇-环烷基、取代或未取代的C₃-C₇-环烷基-C₁-C₈-烷基、取代或未取代的3-氧杂环丁基或取代或未取代的3-硫杂环丁基;

[0022] • Z^2 和 Z^3 可以相同或不同,表示氢原子;取代或未取代的C₁-C₈-烷基;取代或未取代的C₂-C₈-烯基;取代或未取代的C₂-C₈-炔基;氰基;异腈基;硝基;卤原子;取代或未取代的C₁-C₈-烷氧基;取代或未取代的C₂-C₈-烯氧基;取代或未取代的C₂-C₈-炔氧基;取代或未取代的C₃-C₇-环烷基;取代或未取代的C₁-C₈-烷基硫烷基(sulfanyl);取代或未取代的C₁-C₈-烷基磺酰基(sulfonyl);取代或未取代的C₁-C₈-烷基亚磺酰基(sulfinyl);氨基;取代或未取

代的C₁-C₈-烷基氨基;取代或未取代的二-C₁-C₈-烷基氨基;取代或未取代的C₁-C₈-烷氧基羰基;取代或未取代的C₁-C₈-烷基氨基甲酰基;取代或未取代的二-C₁-C₈-烷基氨基甲酰基或取代或未取代的N-C₁-C₈-烷基-C₁-C₈-烷氧基-氨基甲酰基;或者

[0023] • Z²和Z³与它们所连接的碳原子一起形成取代或未取代的C₃-C₇环烷基;或者

[0024] Z³和与B基团的连接点相邻的取代基X、以及它们所连接的连续碳原子一起可形成取代或未取代的5-、6-或7-元部分饱和的碳环或最多包含3个杂原子的杂环;Z²如本文所述;

[0025] • B表示饱和、部分饱和或不饱和的单环或包含1至最多4个选自N、O和S的杂原子的稠合双环4-、5-、6-、7-、8-、9-、10-元环,该环最多可被6个可相同或不同的基团X取代;前提条件是B不是2-吡啶环,以及当Z¹表示取代或未取代的环丙基时,B不是1,3-苯并间二氧杂环戊烯基环(benzodioxolyl);

[0026] • X表示卤原子;硝基;氰基;异腈基;羟基;氨基;硫烷基(sulfanyl);五氟-λ⁶-硫烷基;甲酰基;甲酰氧基;甲酰基氨基;取代或未取代的(羟基亚氨基)-C₁-C₈-烷基;取代或未取代的(C₁-C₈-烷氧基亚氨基)-C₁-C₈-烷基;取代或未取代的(C₂-C₈-烯氧基亚氨基)-C₁-C₈-烷基;取代或未取代的(C₂-C₈-炔氧基亚氨基)-C₁-C₈-烷基;取代或未取代的(苄氧基亚氨基)-C₁-C₈-烷基;羧基;氨基甲酰基;N-羟基氨基甲酰基;氨基甲酸酯基;取代或未取代的C₁-C₈-烷基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷基;取代或未取代的C₂-C₈-烯基;具有1-5个卤原子的C₂-C₈-卤代烯基;取代或未取代的C₂-C₈-炔基;具有1-5个卤原子的C₂-C₈-卤代炔基;取代或未取代的C₁-C₈-烷氧基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷氧基;取代或未取代的C₁-C₈-烷基硫烷基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷基硫烷基;取代或未取代的C₁-C₈-烷基亚磺酰基(sulfinyl);具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷基亚磺酰基;取代或未取代的C₁-C₈-烷基磺酰基(sulfonyl);具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷基磺酰基;取代或未取代的C₁-C₈-烷基氨基;取代或未取代的二-C₁-C₈-烷基氨基;取代或未取代的C₂-C₈-烯氧基;具有1-5个卤原子的C₂-C₈-卤代烯氧基;取代或未取代的C₃-C₈-炔氧基;具有1-5个卤原子的C₂-C₈-卤代炔氧基;取代或未取代的C₃-C₇-环烷基;具有1-5个卤原子的C₃-C₇-卤代环烷基;取代或未取代的(C₃-C₇-环烷基)-C₁-C₈-烷基;取代或未取代的(C₃-C₇-环烷基)-C₂-C₈-烯基;取代或未取代的(C₃-C₇-环烷基)-C₂-C₈-炔基;取代或未取代的三(C₁-C₈)烷基甲硅烷基;取代或未取代的三(C₁-C₈)烷基甲硅烷基-C₁-C₈-烷基;取代或未取代的C₁-C₈-烷基羰基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷基羰基;取代或未取代的C₁-C₈-烷基羰氧基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷基羰氧基;取代或未取代的C₁-C₈-烷基羰基氨基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷基-羰基氨基;取代或未取代的C₁-C₈-烷氧基羰基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷氧基羰基;取代或未取代的C₁-C₈-烷氧基羰氧基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷氧基羰氧基;取代或未取代的C₁-C₈-烷基氨基甲酰基;取代或未取代的二-C₁-C₈-烷基氨基甲酰基;取代或未取代的C₁-C₈-烷基氨基羰氧基;取代或未取代的二-C₁-C₈-烷基氨基羰氧基;取代或未取代的N-(C₁-C₈-烷基)羟基氨基甲酰基;取代或未取代的C₁-C₈-烷氧基氨基甲酰基;取代或未取代的N-(C₁-C₈-烷基)-C₁-C₈-烷氧基氨基甲酰基;最多可被6个可相同或不同的基团Q取代的芳基;最多可被6个可相同或不同的基团Q取代的C₁-C₈-芳基烷基;最多可被6个可相同或不同的基团Q取代的C₂-C₈-芳基烯基;最多可被6个可相同或不同的基团Q取代的C₂-C₈-芳基炔基;最多可被6个可相同或不同的基团Q取代的芳氧基;最多可被6个可相同或不同的基团Q

取代的芳基硫烷基;最多可被6个可相同或不同的基团Q取代的芳基氨基;最多可被6个可相同或不同的基团Q取代的C₁-C₈-芳基烷氧基;最多可被6个可相同或不同的基团Q取代的C₁-C₈-芳基烷基硫烷基;或最多可被6个可相同或不同的基团Q取代的C₁-C₈-芳基烷基氨基;或者

[0027] • 两个取代基X可与它们所连接的连续碳原子一起可形成最多可被4个可相同或不同的基团Q取代的5-或6-元饱和碳环;或者

[0028] • Z³和与B基团的连接点相邻的取代基X、以及它们所连接的连续碳原子一起可形成取代或未取代的5-、6-或7-元部分饱和的碳环或最多包含3个杂原子的杂环;Z²如本文所述;

[0029] • Q独立地表示卤原子;氰基;硝基;取代或未取代的C₁-C₈-烷基;具有1-9个可相同或不同的卤原子的C₁-C₈-卤代烷基;取代或未取代的C₁-C₈-烷氧基;具有1-9个可相同或不同的卤原子的C₁-C₈-卤代烷氧基;取代或未取代的C₁-C₈-烷基硫烷基;具有1-9个可相同或不同的卤原子的C₁-C₈-卤代烷基硫烷基;取代或未取代的三(C₁-C₈)烷基甲硅烷基;取代或未取代的三(C₁-C₈)烷基甲硅烷基-C₁-C₈-烷基;取代或未取代的(C₁-C₈-烷氧基亚氨基)-C₁-C₈-烷基;取代或未取代的(苄氧基亚氨基)-C₁-C₈-烷基。

[0030] 除非另有说明,否则,根据本发明取代的基团或取代基可被一个或多个下列基团或原子取代:卤原子;硝基;羟基;氰基;异腈基;氨基;硫基;五氟-λ⁶-硫烷基;甲酰基;甲酰氧基;甲酰基氨基;氨甲酰基;N-羟基氨甲酰基;氨基甲酸酯基;(羟基亚氨基)-C₁-C₆-烷基;C₁-C₈-烷基;三(C₁-C₈-烷基)甲硅烷基;C₃-C₈-环烷基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷基;具有1-5个卤原子的C₃-C₈-卤代环烷基;C₂-C₈-烯基;C₂-C₈-炔基;C₂-C₈-烯氧基;C₂-C₈-炔氧基;C₁-C₈-烷基氨基;二-C₁-C₈-烷基氨基;C₁-C₈-烷氧基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷氧基;C₁-C₈-烷基硫烷基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷基硫烷基;C₂-C₈-烯氧基;具有1-5个卤原子的C₂-C₈-卤代烯氧基;C₃-C₈-炔氧基;具有1-5个卤原子的C₃-C₈-卤代炔氧基;C₁-C₈-烷基羰基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷基羰基;C₁-C₈-烷基氨甲酰基;二-C₁-C₈-烷基氨甲酰基;N-C₁-C₈-烷氧基氨甲酰基;C₁-C₈-烷氧基氨甲酰基;N-C₁-C₈-烷基-C₁-C₈-烷氧基氨甲酰基;C₁-C₈-烷氧基羰基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷氧基羰基;C₁-C₈-烷基羰氧基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷基羰氧基;C₁-C₈-烷基羰基氨基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷基羰基氨基;C₁-C₈-烷基氨基羰氧基;二-C₁-C₈-烷基氨基羰氧基;C₁-C₈-烷氧基羰氧基;C₁-C₈-烷基硫烷基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷基硫烷基;C₁-C₈-烷基亚磺酰基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷基亚磺酰基;C₁-C₈-烷基磺酰基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷基磺酰基;C₁-C₈-烷基氨基氨基磺酰基;二-C₁-C₈-烷基氨基氨基磺酰基;(C₁-C₆-烷氧基亚氨基)-C₁-C₆-烷基;(C₁-C₆-烯氧基亚氨基)-C₁-C₆-烷基;(C₁-C₆-炔氧基亚氨基)-C₁-C₆-烷基;2-氧代吡咯烷-1-基;(苄氧基亚氨基)-C₁-C₆-烷基;C₁-C₈-烷氧基烷基;具有1-5个卤原子的C₁-C₈-卤代烷氧基烷基;苄氧基;苄基硫烷基;苄基氨基;芳氧基;芳基硫烷基或芳基氨基。

[0031] 本发明的任何化合物可依据该化合物中立体单元(根据IUPAC规则定义)的数目而以一种或多种立体异构体的形式存在。因而本发明同样地涉及所有立体异构体以及所有可能的立体异构体按所有比例的混合物。这些立体异构体可以根据本领域技术人员所熟知的方法进行分离。

[0032] 依据本发明,以下通用术语一般按以下含义使用:

[0033] • 卤素是指氟、氯、溴或碘;

[0034] • 杂原子可以是氮、氧或硫;

[0035] • 任何烷基、烯基或炔基可以是直链或支链的;

[0036] • 术语“芳基”是指苯基或萘基,任选地指取代的苯基或萘基;

[0037] • 在氨基或任何其它含氨基的基团中的氨基部分被两个可相同或不同的取代基取代的情况中,这两个取代基可与它们连接的氮原子一起形成杂环基,优选是5-7元杂环基,该杂环基可被取代,或者可含有其它杂原子,例如吗啉基或哌啶基。

[0038] 优选的依据本发明的通式(I)的化合物是其中 Z^1 表示未取代的环丙基的化合物。

[0039] 依据本发明的其它优选的式(I)化合物是其中 Z^1 表示氢原子的化合物。

[0040] 其它优选的依据本发明的通式(I)的化合物是其中 Z^1 表示甲基或乙基的化合物。

[0041] 其它优选的依据本发明的通式(I)的化合物是其中T表示O的化合物。

[0042] 其它优选的依据本发明的通式(I)的化合物是其中 X^1 表示氟原子的化合物。

[0043] 其它优选的依据本发明的通式(I)的化合物是其中 X^2 表示氟原子的化合物。

[0044] 其它优选的依据本发明的通式(I)的化合物是其中 Z^2 和 Z^3 独立地表示氢原子或甲基的化合物。

[0045] 更优选的依据本发明的通式(I)的化合物是其中 Z^2 表示氢原子, Z^3 表示氢原子或甲基的化合物。

[0046] 其它优选的本发明化合物是具有以下特征的通式(I)的化合物:其中B表示取代或未取代的噻吩环、取代或未取代的苯并噻吩环、取代或未取代的喹啉环、取代或未取代的异喹啉环、或取代或未取代的苯并呋喃环。

[0047] 更优选的本发明化合物是其中B表示取代或未取代的噻吩环的通式(I)的化合物。其它更优选的本发明化合物是其中B表示取代或未取代的苯并噻吩环的通式(I)的化合物。

[0048] 其它优选的本发明化合物是具有以下特征的通式(I)的化合物:其中X独立地表示卤原子;取代或未取代的 C_1-C_8 -烷基;最多含9个可相同或不同的卤原子的 C_1-C_8 -卤代烷基;取代或未取代的 C_1-C_8 -烷氧基或最多含9个可相同或不同的卤原子的 C_1-C_8 -卤代烷氧基。

[0049] 上述关于本发明通式(I)的化合物的取代基的优选方案可以以各种方式进行组合,或者是单独地,部分地或完整地进行组合。这些较好特征的组合由此提供了本发明化合物的亚类。本发明较好的化合物的这些亚类的例子可具有以下组合特征:

[0050] -T的优选特征与一个或多个 X^1 、 X^2 、 Z^1 至 Z^3 、B和X的优选特征;

[0051] - X^1 的优选特征与一个或多个T、 X^2 、 Z^1 至 Z^3 、B和X的优选特征;

[0052] - X^2 的优选特征与一个或多个T、 X^1 、 Z^1 至 Z^3 、B和X的优选特征;

[0053] - Z^1 的优选特征与一个或多个T、 X^1 、 X^2 、 Z^2 、 Z^3 、B和X的优选特征;

[0054] - Z^2 的优选特征与一个或多个T、 X^1 、 X^2 、 Z^1 、 Z^3 、B和X的优选特征;

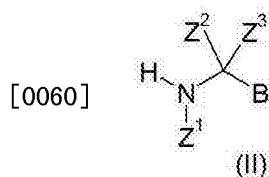
[0055] - Z^3 的优选特征与一个或多个T、 X^1 、 X^2 、 Z^2 、 Z^4 、B和X的优选特征;

[0056] -B的优选特征与一个或多个T、 X^1 、 X^2 、 Z^1 至 Z^3 和X的优选特征;

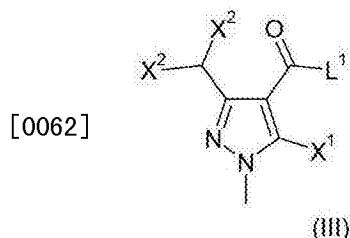
[0057] -X的优选特征与一个或多个T、 X^1 、 X^2 、 Z^1 至 Z^3 和B的优选特征;

[0058] 在这些依据本发明的化合物的取代基的优选特征的组合中,所述优选特征还可选自各T、 X^1 、 X^2 、 Z^1 至 Z^3 、B和X的更优选特征,以形成最优选的依据本发明的化合物的亚类。

[0059] 本发明还涉及制备通式(I)化合物的方法。因此,依据本发明的另一方面,提供一种制备文中定义的通式(I)的化合物的方法P1,其中T表示O,该方法包括在催化剂存在下,并且在 L^1 表示羟基的情况中在缩合剂存在下,以及在 L^1 表示卤原子的情况中在酸结合剂存在下,使通式(II)的N-取代的胺衍生物或其一种盐与通式(III)的羧酸衍生物反应:



[0061] 式中 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 和B如文中所定义;



[0063] 式中, X^1 和 X^2 如文中所定义, L^1 表示选自下组的离去基团:卤原子、羟基、 $-OR^a$ 、 $-OC(=O)R^a$, R^a 是取代或未取代的 C_1 - C_6 -烷基,取代或未取代的 C_1 - C_6 -卤代烷基、苄基、4-甲氧基苄基或五氟苄基。

[0064] 通式(II)的N-取代胺衍生物是已知的,或者可通过已知方法制备,例如醛或酮的还原氨化(Bioorganics and Medicinal Chemistry Letters(2006),2014),或亚胺的还原(Tetrahedron(2005),11689),或卤素、甲磺酸酯或甲苯磺酸酯的亲核取代(Journal of Medicinal Chemistry(2002),3887)。

[0065] 通式(III)的羧酸衍生物可通过方法P2制备。

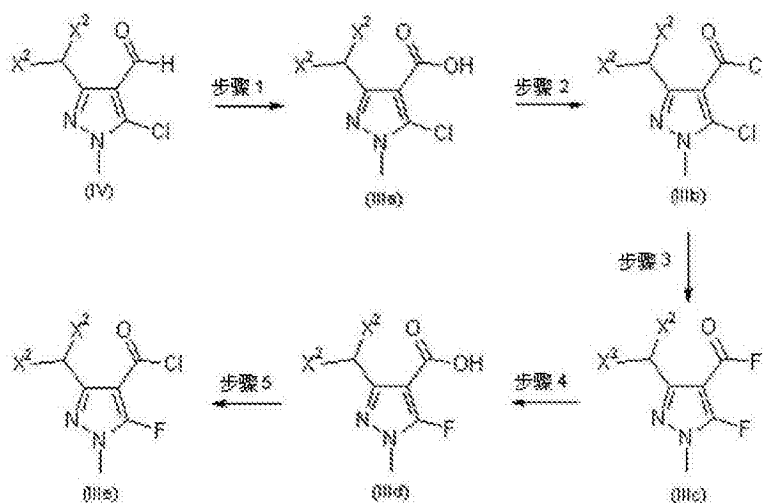
[0066] 在 L^1 表示表示羟基的情况中,本发明方法在缩合剂存在下进行。合适的缩合剂可非限制性地选自下组:例如酰卤形成剂,例如光气、三溴化磷、三氯化磷、五氯化磷、氧化三氯化磷或亚硫酸酐;酸酐形成剂,例如氯甲酸乙酯、氯甲酸甲酯、氯甲酸异丙酯、氯甲酸异丁酯或甲磺酰氯;碳二亚胺,例如N,N'-二环己基碳二亚胺(DCC);或其它常规缩合剂,例如五氧化二磷、多磷酸、N,N'-羰基-二咪唑、2-乙氧基-N-乙氧基羰基-1,2-二氢喹啉(EEDQ)、三苯基膦/四氯甲烷、水合氯化4-(4,6-二甲氧基[1.3.5]三嗪-2-基)-4-甲基吗啉鎓盐、溴-三吡咯烷基(tripyrrolidino)磷六氟磷酸盐或丙烷膦酸酐(T3P)。

[0067] 本发明方法在催化剂存在下进行。合适的催化剂可选自4-二甲基-氨基吡啶、1-羟基-苯并三唑或二甲基甲酰胺。

[0068] 在 L^1 表示卤原子的情况中,本发明方法在酸结合剂存在下进行。在各种情况中,适用于进行依据本发明的方法P1的酸结合剂是所有常用于这类反应的无机碱和有机碱。优选使用碱土金属、碱金属氢化物,碱金属氢氧化物或碱金属醇盐,例如氢氧化钠、氢化钠、氢氧化钙、氢氧化钾、叔丁醇钾或其它氢氧化铵;碱金属碳酸盐,例如碳酸铯、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钾、碳酸氢钠;碱金属或碱土金属乙酸盐,例如乙酸钠、乙酸钾、乙酸钙;以及叔胺类,例如三甲胺、三乙胺、二异丙基乙胺、三丁胺、N,N-二甲基苯胺、吡啶、N-甲基哌啶、N,N-二甲基氨基吡啶、二氮杂二环辛烷(DABCO)、二氮杂二环壬烯(DBN)或二氮杂二环十一碳烯(DBU)。

[0069] 还可以在无任何额外的缩合剂存在的情况下进行反应,或者使用过量的胺组分,使得该组分可以同时作为酸结合剂。

[0070] 依据本发明的另一方面,提供一种制备通式(III)的羧酸衍生物的方法P2,其中T表示O,并如下反应方案所示:



[0071]

[0072] 方法P2

[0073] 其中X²如文中所定义;

[0074] 5-氯-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醛(carbaldehyde)是已知的,参见W0-2004/014138(参考实施例35)。

[0075] 方法P2的步骤1在氧化剂存在下进行,并且如果合适,还在溶剂存在下进行。

[0076] 方法P2的步骤2和5在酰卤存在下进行,并且如果合适,还在溶剂存在下进行。

[0077] 方法P2的步骤3在氟化剂存在下进行,并且如果合适,还在溶剂存在下进行。

[0078] 方法P2的步骤4在酸或碱存在下进行,并且如果合适,还在溶剂存在下进行。

[0079] 在各情况中,适用于进行本发明方法P2的步骤1的氧化剂是所有常用于这类反应的无机和有机氧化剂。优选使用高锰酸苄基三乙基铵;溴;氯;间氯过苯甲酸;铬酸;氧化铬(VI);过氧化氢;过氧化氢-三氟化硼;过氧化氢-脲;2-羟基过氧六氟-2-丙醇;碘;氧-铂催化剂,过苯甲酸;硝酸过氧化乙酰(peroxyacetyl nitrate);高锰酸钾;钨酸钾;二铬酸吡啶;氧化钨(VIII);氧化银(I);氧化银(II);硝酸银;亚氯酸钠;次氯酸钠;2,2,6,6-四甲基哌啶-1-氧基。

[0080] 在各情况中,适用于进行本发明方法P2的步骤2和5的酰卤是常用于这类反应的所有有机或无机酰卤。优选使用光气、三氯化磷、五氯化磷、三氯氧化磷;亚硫酰氯;或四氯化碳-三苯基膦。

[0081] 在各情况中,适用于进行本发明方法P2的步骤3的氟化剂是常用于这类反应的所有氟化剂。优选使用氟化铯、氟化钾、氟化钾-二氟化钙或氟化四丁铵。

[0082] 当进行本发明方法P2的步骤1-5时,反应温度可以独立地在较宽的范围内变化。通常,本发明方法在0-160°C的温度下进行,优选在10-120°C的温度下进行。控制本发明方法的温度的一种方法是使用微波技术。

[0083] 依据本发明的方法P2的步骤1-5一般独立地在大气压下进行。但是,在各情况中,也可以在升高或降低的压力下进行。

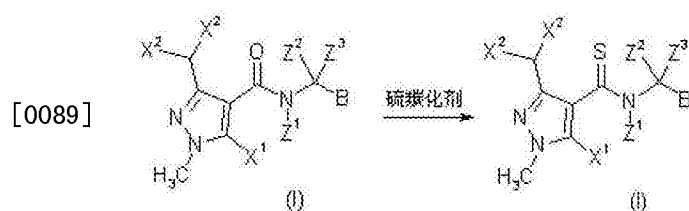
[0084] 在进行本发明方法P2的步骤1时,对于每摩尔通式(IV)的醛,一般使用1摩尔或过量的氧化剂。还可以其它比例使用反应组分。

[0085] 在进行本发明方法P2的步骤2和5时,对于每摩尔通式(IIIa)或(IIIId)的酸,一般使用1摩尔或过量的酰卤。还可以其它比例使用反应组分。

[0086] 在进行本发明方法P2的步骤3时,对于每摩尔通式(IIIb)的酰氯,一般使用1摩尔或过量的氟化剂。还可以其它比例使用反应组分。

[0087] 在进行本发明方法P2的步骤4时,对于每摩尔通式(IIIc)的酰氟,一般使用1摩尔或过量的酸或碱。还可以其它比例使用反应组分。

[0088] 依据本发明的另一方面,提供一种制备通式(I)的化合物的方法P3,其中T表示S,该方法原料为其中T表示O的通式(I)的化合物,并如以下反应方案所示:



[0090] 方法P3

[0091] 式中 X^1 、 X^2 、 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 和B如文中所定义,该方法任选地在催化量、符合化学计量的量或过量的碱存在下进行,所述碱例如是无机或有机碱。优选使用碱金属碳酸盐,例如碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钾、碳酸氢钠;杂环芳族碱,例如吡啶、甲基吡啶、二甲基吡啶、三甲基吡啶;以及叔胺类,例如三甲胺、三乙胺、三丁胺、N,N-二甲苯胺、N,N-二甲氨基吡啶或N-甲基-哌啶。

[0092] 本发明方法P3在硫羰化剂(thionating agent)存在下进行。

[0093] 通式(I)的原料酰胺衍生物依据方法P1制备。

[0094] 适用于进行本发明方法P3的硫羰化剂可以是硫(S)、氢硫酸(H_2S)、硫化钠(Na_2S)、硫化氢钠($NaHS$)、三硫化二硼(B_2S_3)、硫化二(二乙基铝)($(AlEt_2)_2S$)、硫化铵($(NH_4)_2S$)、五硫化二磷(P_2S_5)、拉韦松试剂(Lawesson's reagent)(2,4-二(4-甲氧基苯基)-1,2,3,4-二硫杂二磷杂环丁烷(dithiadiphos-phetane)2,4-二硫化物)或聚合物负载的硫羰化剂,例如Journal of the Chemical Society, Perkin1, (2001), 358中所述。

[0095] 按照常用方法来实施后处理(Work-up)。通常,用水对反应混合物进行处理,并分离出有机相,干燥后在减压条件下浓缩。如果合适,可通过常用方法(例如色谱法、重结晶或蒸馏)除去剩余残留物中可能仍存在的任何杂质。

[0096] 本发明的化合物可依据上述一般制备方法制备。然而要理解,本领域技术人员基于其所掌握的常识和可获得的出版物,可以根据所需合成的各种具体的本发明化合物对本发明方法进行相应调整。

[0097] 在另一方面,本发明还涉及含有有效且非植物毒性量的通式(I)的活性化合物的杀真菌剂组合物。

[0098] 术语“有效且非植物毒性量”指本发明组合物的量足以控制或破坏存在于或易于出现在作物上的真菌,而该剂量并不会使所述作物产生任何可以观察到的植物毒性症状。该量根据以下因素可在很宽的范围内变化:要控制的真菌、作物的类型、气候条件和包含在

本发明的杀真菌组合物中的化合物。该量可通过系统性田间试验来确定,这在本领域技术人员的能力范围内。

[0099] 因此,本发明提供了一种杀真菌剂组合物,该组合物包含:有效量的如本文所定义的通式(I)化合物作为活性成分、以及农业上可接受的担体(support)、载体或填料(filler)。

[0100] 依据本发明,术语“担体”表示天然或合成的有机或无机化合物,它与通式(I)的活性化合物组合或联合使用,使活性化合物更容易施用,特别是施用到植物各部分上。因此,此担体通常是惰性的,并且应该是农业上可接受的。担体可为固体或液体。合适的担体的例子包括粘土、天然或合成的硅酸盐、氧化硅、树脂、蜡、固体肥料、水、醇(特别是丁醇)、有机溶剂、矿物油和植物油以及它们的衍生物。也可以使用此类担体的混合物。

[0101] 本发明的组合物还可以包含其它组分。具体地,所述组合物还可包含表面活性剂。所述表面活性剂可为离子型或非离子型的乳化剂、分散剂或润湿剂、或这些表面活性剂的混合物。例如,聚丙烯酸盐、木质素磺酸盐、苯酚磺酸盐或萘磺酸盐、环氧乙烷与脂肪醇或脂肪酸或脂肪胺的缩聚物、取代的苯酚(特别是烷基苯酚或芳基苯酚)、磺基琥珀酸酯的盐、牛磺酸衍生物(特别是牛磺酸烷基酯(alkyl taurate))、聚氧乙基化醇或苯酚的磷酸酯、多元醇的脂肪酸酯,以及含有硫酸、磺酸和磷酸官能团的上述化合物的衍生物。当活性化合物和/或惰性担体不溶于水并且当施用的媒介试剂是水时,至少一种表面活性剂的存在通常是至关重要的。较佳地,以组合物的重量计,表面活性剂的含量为5-40重量%。

[0102] 任选地,还可包括其它组分,例如,保护性胶体、粘合剂、增稠剂、触变剂、渗透剂、稳定剂、螯合剂。一般来说,活性化合物可根据常用的配方技术与任何固体或液体添加剂相混合。

[0103] 通常,本发明的组合物可包含0.05-99重量%的活性化合物,优选为10-70重量%。

[0104] 本发明的组合物可以以各种形式使用,例如气溶胶分散剂、胶囊悬浮剂、冷雾浓缩剂、可撒粉剂、可乳化的浓缩剂、水包油乳液、油包水乳液、包封的颗粒、精细颗粒、种子处理用悬浮剂(flowable concentrate)、气体(在施加压力的条件下)、气体发生剂、颗粒、热雾浓缩剂、大颗粒、微颗粒、油可分散性粉剂、油混溶性悬浮剂、油混溶性液体、糊料、植物小棒、干种子处理用粉剂、经农药涂覆的种子、可溶性浓缩物、可溶性粉剂、种子处理液剂、悬浮浓缩物(可流动浓缩物)、超低容量(ULV)液体、超低容量(ULV)悬浮液、水可分散性颗粒或片剂、浆液处理用水可分散粉剂、水溶性颗粒或片剂、种子处理用水溶性粉剂、以及可润湿性粉剂。这些组合物不仅包括用合适的设备如喷雾器或撒粉设备等施用到待处理的植物或种子上的现成组合物,而且包括在施用于农作物之前必须进行稀释的浓缩商品组合物。

[0105] 本发明的化合物还可与一种或多种以下物质混合:杀虫剂、杀真菌剂、杀细菌剂、引诱剂、杀螨剂或信息素活性物质或者有生物活性的其它化合物。如此获得的混合物通常具有广谱的活性。与其它杀真菌剂化合物的混合物特别有益。

[0106] 合适的杀真菌剂混合配合剂的例子可选自下组:

[0107] (1)麦角固醇生物合成的抑制剂,例如(1.1)阿尔迪莫(alldimorph)(1704-28-5)、(1.2)氮康唑(60207-31-0)、(1.3)联苯三唑醇(55179-31-2)、(1.4)糠菌唑(116255-48-2)、(1.5)环丙唑醇(113096-99-4)、(1.6)苄氯三唑醇(75736-33-3)、(1.7)苯醚甲环唑(119446-68-3)、(1.8)烯唑醇(83657-24-3)、(1.9)烯唑醇-M(83657-18-5)、(1.10)十二环

吗啉(1593-77-7)、(1.11)乙酸十二环吗啉(31717-87-0)、(1.12)氟环唑(106325-08-0)、(1.13)乙环唑(60207-93-4)、(1.14)氯苯嘧啶醇(60168-88-9)、(1.15)腈苯唑(114369-43-6)、(1.16)环酰菌胺(126833-17-8)、(1.17)苯锈啉(67306-00-7)、(1.18)丁苯吗啉(67306-03-0)、(1.19)氟唑唑(136426-54-5)、(1.20)呋啉醇(56425-91-3)、(1.21)氟硅唑(85509-19-9)、(1.22)粉唑醇(76674-21-0)、(1.23)呋菌唑(112839-33-5)、(1.24)呋醚唑-顺式(112839-32-4)、(1.25)己唑醇(79983-71-4)、(1.26)抑霉唑(60534-80-7)、(1.27)抑霉唑硫酸盐(58594-72-2)、(1.28)亚胺唑(86598-92-7)、(1.29)种菌唑(125225-28-7)、(1.30)叶菌唑(125116-23-6)、(1.31)腈菌唑(88671-89-0)、(1.32)萘替芬(65472-88-0)、(1.33)氟苯嘧啶醇(63284-71-9)、(1.34)恶咪唑(174212-12-5)、(1.35)多效唑(76738-62-0)、(1.36)稻瘟酯(101903-30-4)、(1.37)戊菌唑(66246-88-6)、(1.38)病花灵(3478-94-2)、(1.39)咪鲜胺(67747-09-5)、(1.40)丙环唑(60207-90-1)、(1.41)丙硫菌唑(178928-70-6)、(1.42)稗草丹(88678-67-5)、(1.43)啉斑肟(88283-41-4)、(1.44)喹啉康唑(quinconazole)(103970-75-8)、(1.45)硅氟唑(149508-90-7)、(1.46)螺环菌胺(118134-30-8)、(1.47)戊唑醇(107534-96-3)、(1.48)特比萘芬(91161-71-6)、(1.49)四氟醚唑(112281-77-3)、(1.50)三唑酮(43121-43-3)、(1.51)三唑醇(89482-17-7)、(1.52)十三吗啉(81412-43-3)、(1.53)氟菌唑(68694-11-1)、(1.54)噻胺灵(26644-46-2)、(1.55)灭菌唑(131983-72-7)、(1.56)烯效唑(83657-22-1)、(1.57)单克素(83657-17-4)、(1.58)烯霜苄(77174-66-4)、(1.59)伏立康唑(137234-62-9)、(1.60)1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)环庚醇(129586-32-9)、(1.61)1-(2,2-二甲基-2,3-二氢-1H-茛-1-基)-1H-咪唑-5-甲酸甲酯(110323-95-0)、(1.62)N'-{5-(二氟甲基)-2-甲基-4-[3-(三甲基甲硅烷基)丙氧基]苯基}-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(1.63)N-乙基-N-甲基-N'-{2-甲基-5-(三氟甲基)-4-[3-(三甲基甲硅烷基)丙氧基]苯基}亚氨基甲酰胺和(1.64)O-[1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁-2-基]1H-咪唑-1-硫代羧酸酯(O-[1-(4-methoxyphenoxy)-3,3-dimethylbutan-2-yl]1H-imidazole-1-carbothioate)(111226-71-2)。

[0108] (2)呼吸链复合物I或II的抑制剂,例如(2.1)联苯吡菌胺(bixafen)(581809-46-3)、(2.2)啉酰菌胺(188425-85-6)、(2.3)萎锈灵(5234-68-4)、(2.4)二氟林(130339-07-0)、(2.5)甲呋酰胺(24691-80-3)、(2.6)氟吡菌酰胺(658066-35-4)、(2.7)氟酰胺(66332-96-5)、(2.8)氟唑菌酰胺(907204-31-3)、(2.9)呋吡菌胺(123572-88-3)、(2.10)拌种胺(60568-05-0)、(2.11)吡唑萘菌胺(顺-差向外消旋体1RS,4SR,9RS和反-差向外消旋体1RS,4SR,9SR的混合物)(881685-58-1)、(2.12)异赛派泽姆(反-差向外消旋体1RS,4SR,9SR)、(2.13)吡唑萘菌胺(反-差向对映异构体1R,4S,9S)、(2.14)吡唑萘菌胺(反-差向对映异构体1S,4R,9R)、(2.15)吡唑萘菌胺(顺-差向外消旋体1RS,4SR,9RS)、(2.16)吡唑萘菌胺(顺-差向对映异构体1R,4S,9R)、(2.17)吡唑萘菌胺(顺-差向对映异构体1S,4R,9S)、(2.18)灭锈胺(55814-41-0)、(2.19)氧化萎锈灵(5259-88-1)、(2.20)戊苯吡菌胺(494793-67-8)、(2.21)吡噻菌胺(183675-82-3)、(2.22)环丙吡菌胺(sedaxane)(874967-67-6)、(2.23)噻呋酰胺(130000-40-7)、(2.24)1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.25)3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.26)3-(二氟甲基)-N-[4-氟-2-(1,1,2,3,3,3-六氟丙氧基)苯基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.27)N-[1-(2,4-二氯苯基)-1-甲氧基丙-2-基]-3-(二氟甲基)-

1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺(1092400-95-7)(W02008148570)、(2.28)5,8-二氟-N-[2-(2-氟-4-{[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]氧}苯基)乙基]喹唑啉-4-胺(1210070-84-0)(W02010025451)、(2.29)N-[9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-亚甲基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.30)N-[(1S,4R)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-亚甲基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺以及(2.31)N-[(1R,4S)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-亚甲基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺。

[0109] (3)呼吸链复合物III的抑制剂,例如(3.1)辛唑啉菌胺(ametoctradin)(865318-97-4)、(3.2)吡唑磺菌胺(348635-87-0)、(3.3)嘧菌酯(131860-33-8)、(3.4)氰霜唑(120116-88-3)、(3.5)甲氧菌酯(850881-30-0)、(3.6)丁香菌酯(850881-70-8)、(3.7)醚菌胺(141600-52-4)、(3.8)烯肟菌酯(238410-11-2)(W02004/058723)、(3.9)噁唑酮菌(131807-57-3)(W02004/058723)、(3.10)咪唑菌酮(161326-34-7)(W02004/058723)、(3.11)菌螨酯(fenoxystrobin)(918162-02-4)、(3.12)氟嘧菌酯(361377-29-9)(W02004/058723)、(3.13)醚菌酯(143390-89-0)(W02004/058723)、(3.14)苯氧菌胺(133408-50-1)(W02004/058723)、(3.15)肟醚菌胺(189892-69-1)(W02004/058723)、(3.16)啉氧菌酯(117428-22-5)(W02004/058723)、(3.17)双唑草腈(175013-18-0)(W02004/058723)、(3.18)唑胺菌酯(915410-70-7)(W02004/058723)、(3.19)唑菌酯(862588-11-2)(W02004/058723)、(3.20)嘧啶肟草醚(799247-52-2)(W02004/058723)、(3.21)三环吡菌威(triclopyricarb)(902760-40-1)、(3.22)肟菌酯(141517-21-7)(W02004/058723)、(3.23)(2E)-2-(2-{[6-(3-氯-2-甲基苯氧基)-5-氟嘧啶-4-基]氧基}苯基)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺(W02004/058723)、(3.24)(2E)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-2-(2-[(1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]氨基)氧基]甲基]苯基)乙酰胺(W02004/058723)、(3.25)(2E)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-2-{2-[(E)-({1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基}亚氨基)甲基]苯基}乙酰胺(158169-73-4)、(3.26)(2E)-2-{2-[(1E)-1-(3-{[(E)-1-氟-2-苯基乙烯基]氧基}苯基)亚乙基]氨基}氧基]甲基]苯基}-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺(326896-28-0)、(3.27)(2E)-2-{2-[(2E,3E)-4-(2,6-二氯苯基)丁-3-烯-2-亚基]氨基}氧基]甲基]苯基}-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、(3.28)2-氯-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)吡啶-3-甲酰胺(119899-14-8)、(3.29)5-甲氧基-2-甲基-4-(2-{[(1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]氨基}氧基]甲基]苯基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮、(3.30)(2E)-2-{2-[(环丙基[(4-甲氧基苯基)亚氨基]甲基]硫烷基)甲基]苯基}-3-甲氧基丙-2-烯酸甲酯(149601-03-6)、(3.31)N-(3-乙基-3,5,5-三甲基环己基)-3-(甲酰氨基)-2-羟基苯甲酰胺(226551-21-9)、(3.32)2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺(173662-97-0)以及(3.33)(2R)-2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺(394657-24-0)。

[0110] (4)有丝分裂和细胞分化的抑制剂,例如(4.1)苯菌灵(17804-35-2)、(4.2)多菌灵(10605-21-7)、(4.3)苯咪唑菌(3574-96-7)、(4.4)乙霉威(87130-20-9)、(4.5)噻唑菌胺(162650-77-3)、(4.6)氟吡菌胺(239110-15-7)、(4.7)麦穗宁(3878-19-1)、(4.8)戊菌隆(66063-05-6)、(4.9)噻菌灵(148-79-8)、(4.10)甲基硫菌灵(23564-05-8)、(4.11)硫菌灵(23564-06-9)、(4.12)苯酰菌胺(156052-68-5)、(4.13)5-氯-7-(4-甲基哌啶-1-基)-6-(2,

4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶(214706-53-3)以及(4.14)3-氯-5-(6-氯吡啶-3-基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)哒嗪(1002756-87-7)。

[0111] (5)能够具有多位点作用的化合物,例如(5.1)波尔多液(8011-63-0)、(5.2)敌菌丹(2425-06-1)、(5.3)克菌丹(133-06-2)(W002/12172)、(5.4)百菌清(1897-45-6)、(5.5)氢氧化铜(20427-59-2)、(5.6)环烷酸铜(1338-02-9)、(5.7)氧化铜(1317-39-1)、(5.8)氯氧化铜(1332-40-7)、(5.9)硫酸铜(2+)(7758-98-7)、(5.10)苯氟磺胺(1085-98-9)、(5.11)二噻农(3347-22-6)、(5.12)多果定(2439-10-3)、(5.13)多果定游离碱、(5.14)福美铁(14484-64-1)、(5.15)氟佛匹特(719-96-0)、(5.16)灭菌丹(133-07-3)、(5.17)双胍盐(108173-90-6)、(5.18)双胍辛胺乙酸盐、(5.19)双胍辛胺(13516-27-3)、(5.20)双胍辛胺苄磺酸盐(169202-06-6)、(5.21)双胍辛胺乙酸盐(57520-17-9)、(5.22)代森锰铜(53988-93-5)、(5.23)代森锰锌(8018-01-7)、(5.24)代森锰(12427-38-2)、(5.25)代森联(9006-42-2)、(5.26)代森联锌(metiram zinc)(9006-42-2)、(5.27)喹啉铜(10380-28-6)、(5.28)丙烷脒(104-32-5)、(5.29)丙森锌(12071-83-9)、(5.30)硫磺和包括多硫化钙的硫磺制剂(7704-34-9)、(5.31)福美双(137-26-8)、(5.32)对甲抑菌灵(731-27-1)、(5.33)代森锌(12122-67-7)以及(5.34)福美锌(137-30-4)。

[0112] (6)能够诱导宿主防御的化合物,例如(6.1)阿拉酸式苯-S-甲基(135158-54-2)、(6.2)异噻菌胺(224049-04-1)、(6.3)噻菌灵(27605-76-1)以及(6.4)噻酰菌胺(223580-51-6)。

[0113] (7)氨基酸和/或蛋白质生物合成的抑制剂,例如(7.1)胺扑灭(23951-85-1)、(7.2)灰瘟素(2079-00-7)、(7.3)噻菌环胺(121552-61-2)、(7.4)春雷霉素(6980-18-3)、(7.5)春雷霉素盐酸盐水合物(19408-46-9)、(7.6)噻菌胺(110235-47-7)、(7.7)噻霉胺(53112-28-0)以及(7.8)3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉(861647-32-7)(W02005070917)。

[0114] (8)ATP产生的抑制剂,例如(8.1)三苯基乙酸锡(900-95-8)、(8.2)三苯基氯化锡(639-58-7)、(8.3)三苯基氢氧化锡(76-87-9)以及(8.4)硅噻菌胺(175217-20-6)。

[0115] (9)细胞壁合成的抑制剂,例如(9.1)苯噻菌胺(177406-68-7)、(9.2)烯酰吗啉(110488-70-5)、(9.3)氟吗啉(211867-47-9)、(9.4)异丙菌威(140923-17-7)、(9.5)双炔酰菌胺(374726-62-2)、(9.6)多抗霉素(11113-80-7)、(9.7)多氧霉素(22976-86-9)、(9.8)井冈霉素A(37248-47-8)以及(9.9)霜霉灭(valifenalate)(283159-94-4;283159-90-0)。

[0116] (10)脂和膜合成的抑制剂,例如(10.1)联苯(92-52-4)、(10.2)地茂散(2675-77-6)、(10.3)氯硝胺(99-30-9)、(10.4)克瘟散(17109-49-8)、(10.5)土菌灵(2593-15-9)、(10.6)依杜卡(iodocarb)(55406-53-6)、(10.7)异稻瘟净(26087-47-8)、(10.8)稻瘟灵(50512-35-1)、(10.9)霜霉威(25606-41-1)、(10.10)霜霉威盐酸盐(25606-41-1)、(10.11)硫菌威(19622-08-3)、(10.12)定菌磷(13457-18-6)、(10.13)五氯硝基苯(82-68-8)、(10.14)四氧硝基苯(117-18-0)以及(10.15)甲基立枯磷(57018-04-9)。

[0117] (11)黑素生物合成的抑制剂,例如(11.1)环丙酰菌胺(104030-54-8)、(11.2)双氯氰菌胺(139920-32-4)、(11.3)氰菌胺(115852-48-7)、(11.4)四氯苯酞(27355-22-2)、(11.5)咯喹酮(57369-32-1)、(11.6)三环唑(41814-78-2)以及(11.7){3-甲基-1-[(4-甲基苯甲酰基)氨基]丁-2-基}氨基甲酸2,2,2-三氟乙基酯(851524-22-6)(W02005042474)。

[0118] (12)核酸合成的抑制剂,例如(12.1)苯霜灵(71626-11-4)、(12.2)苯霜灵-M(kiralaxyl)(98243-83-5)、(12.3)乙嘧酚磺酸酯(41483-43-6)、(12.4)柯罗泽尔昆(clozylacon)(67932-85-8)、(12.5)甲菌定(5221-53-4)、(12.6)乙嘧酚(23947-60-6)、(12.7)呋霜灵(57646-30-7)、(12.8)恶霉灵(10004-44-1)、(12.9)甲霜灵(57837-19-1)、(12.10)高效甲霜灵(mefenoxam)(70630-17-0)、(12.11)呋酰胺(58810-48-3)、(12.12)恶霜灵(77732-09-3)以及(12.13)恶唑酸(14698-29-4)。

[0119] (13)信号转导的抑制剂,例如(13.1)乙菌利(84332-86-5)、(13.2)拌种咯(74738-17-3)、(13.3)咯菌腈(131341-86-1)、(13.4)异菌脲(36734-19-7)、(13.5)腐霉利(32809-16-8)、(13.6)苯氧喹啉(124495-18-7)以及(13.7)乙烯菌核利(50471-44-8)。

[0120] (14)能够用作解偶联剂的化合物,例如(14.1)乐杀螨(485-31-4)、(14.2)消螨普(131-72-6)、(14.3)噻菌脲(89269-64-7)、(14.4)氟啶胺(79622-59-6)以及(14.5)消螨多(meptyldinocap)(131-72-6)。

[0121] (15)其它化合物,例如(15.1)苯噻硫氰(21564-17-0)、(15.2)贝斯氧杂嗪(bethoxazin)(163269-30-5)、(15.3)卡巴西霉素(capsimycin)(70694-08-5)、(15.4)香芹酮(99-49-0)、(15.5)灭螨猛(2439-01-2)、(15.6)甲氧苯啉菌(pyriofenone)(氯芬酮(chlazafenone))(688046-61-9)、(15.7)硫杂灵(11096-18-7)、(15.8)环氟菌胺(180409-60-3)、(15.9)霜脲氰(57966-95-7)、(15.10)啉酰菌胺(221667-31-8)、(15.11)棉隆(533-74-4)、(15.12)咪菌威(62732-91-6)、(15.13)双氯酚(97-23-4)、(15.14)哒菌酮(62865-36-5)、(15.15)野燕枯(49866-87-7)、(15.16)苯敌快(43222-48-6)、(15.17)二苯胺(122-39-4)、(15.18)乙克霉特、(15.19)胺苯吡菌酮(473798-59-3)、(15.20)氟酰菌胺(154025-04-4)、(15.21)唑呋草(41205-21-4)、(15.22)磺菌胺(106917-52-6)、(15.23)氟噻菌(flutianil)(304900-25-2)、(15.24)三乙膦酸铝(39148-24-8)、(15.25)三乙膦酸钙、(15.26)三乙膦酸钠(39148-16-8)、(15.27)六氯苯(118-74-1)、(15.28)人间霉素(81604-73-1)、(15.29)磺菌威(66952-49-6)、(15.30)异硫氰酸甲酯(556-61-6)、(15.31)苯菌酮(220899-03-6)、(15.32)米多霉素(67527-71-3)、(15.33)纳他霉素(7681-93-8)、(15.34)二甲氨基二硫代甲酸镍(15521-65-0)、(15.35)酞菌酯(10552-74-6)、(15.36)辛噻酮(26530-20-1)、(15.37)奥克斯莫卡宾(oxamocarb)(917242-12-7)、(15.38)氧代奋欣(oxyfenthiin)(34407-87-9)、(15.39)五氯苯酚及盐(87-86-5)、(15.40)苯醚菊酯、(15.41)亚磷酸及其盐(13598-36-2)、(15.42)霜霉威乙膦酸盐(propamocarb-fosetylalte)、(15.43)丙烷辛钠(propanosine-sodium)(88498-02-6)、(15.44)丙氧喹啉(189278-12-4)、(15.45)丁吡吗啉(868390-90-3)、(15.45e)(2E)-3-(4-叔丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(吗啉-4-基)丙-2-烯-1-酮(1231776-28-5)、(15.45z)(2Z)-3-(4-叔丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(吗啉-4-基)丙-2-烯-1-酮(1231776-29-6)、(15.46)吡咯尼群(1018-71-9)(EP-A1559320)、(15.47)特弗喹啉(tebufloquin)(376645-78-2)、(15.48)叶枯酞(76280-91-6)、(15.49)甲磺菌胺(304911-98-6)、(15.50)咪唑嗪(72459-58-6)、(15.51)水杨菌胺(70193-21-4)、(15.52)氰菌胺(84527-51-5)、(15.53)(3S,6S,7R,8R)-8-苄基-3-[(3-[(异丁酰氧基)甲氧基]-4-甲氧基吡啶-2-基)羰基]氨基]-6-甲基-4,9-二氧代-1,5-二氧戊环(dioxonan)-7-基2-甲基丙酸酯(517875-34-2)(W02003035617)、(15.54)1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基})

哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮(1003319-79-6)(W02008013622)、(15.55)1-(4-{4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮(1003319-80-9)(W02008013622)、(15.56)1-(4-{4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮(1003318-67-9)(W02008013622)、(15.57)1H-咪唑-1-甲酸1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁-2-基酯(111227-17-9)、(15.58)2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺酰基)吡啶(13108-52-6)、(15.59)2,3-二丁基-6-氯噻吩并[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮(221451-58-7)、(15.60)2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二硫代(dithiino)[2,3-c:5,6-c']二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮、(15.61)2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)乙酮(1003316-53-7)(W02008013622)、(15.62)2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)乙酮(1003316-54-8)(W02008013622)、(15.63)2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-{4-[4-(5-苯基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基)-1,3-噻唑-2-基]哌啶-1-基}乙酮(1003316-51-5)(W02008013622)、(15.64)2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4H-色烯-4-酮、(15.65)2-氯-5-[2-氯-1-(2,6-二氟-4-甲氧基苯基)-4-甲基-1H-咪唑-5-基]吡啶、(15.66)2-苯基苯酚及盐(90-43-7)、(15.67)3-(4,4,5-三氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉(861647-85-0)(W02005070917)、(15.68)3,4,5-三氯吡啶-2,6-二腈(17824-85-0)、(15.69)3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基-1,2-噁唑烷-3-基]吡啶、(15.70)3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基哒嗪、(15.71)4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基哒嗪、(15.72)5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇、(15.73)5-氯-N'-苯基-N'-(丙-2-炔-1-基)噻吩-2-磺酰肼(134-31-6)、(15.74)5-氟-2-[(4-氟苄基)氧基]嘧啶-4-胺(1174376-11-4)(W02009094442)、(15.75)5-氟-2-[(4-甲基苄基)氧基]嘧啶-4-胺(1174376-25-0)(W02009094442)、(15.76)5-甲基-6-辛基[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-7-胺、(15.77)(2Z)-3-氨基-2-氰基-3-苯基丙-2-烯酸乙酯、(15.78)N'-(4-{[3-(4-氯苄基)-1,2,4-噻二唑-5-基]氧基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.79)N-(4-氯苄基)-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]丙酰胺、(15.80)N-[(4-氯苯基)(氰基)甲基]-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]丙酰胺、(15.81)N-[(5-溴-3-氯吡啶-2-基)甲基]-2,4-二氯吡啶-3-甲酰胺、(15.82)N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯吡啶-3-甲酰胺、(15.83)N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2-氟-4-碘吡啶-3-甲酰胺、(15.84)N-{(E)-[(环丙基甲氧基)亚氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苯基乙酰胺(221201-92-9)、(15.85)N-{(Z)-[(环丙基甲氧基)亚氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苯基乙酰胺(221201-92-9)、(15.86)N'-{4-[(3-叔丁基-4-氰基-1,2-噁唑-5-基)氧基]-2-氯-5-甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.87)N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-(1,2,3,4-四氢萘-1-基)-1,3-噻唑-4-甲酰胺(922514-49-6)(W02007014290)、(15.88)N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-[(1R)-1,2,3,4-四氢萘-1-基]-1,3-噻唑-4-甲酰胺(922514-07-6)(W02007014290)、(15.89)N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-[(1S)-1,2,3,4-四氢萘-1-基]-

1,3-噻唑-4-甲酰胺(922514-48-5)(W02007014290)、(15.90){6-[(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基}氧基]甲基]吡啶-2-基}氨基甲酸戊酯、(15.91)吩噻-1-甲酸、(15.92)喹啉-8-醇(134-31-6)、(15.93)喹啉-8-醇硫酸酯(2:1)(134-31-6)以及(15.94){6-[(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基}氧基]甲基]吡啶-2-基}氨基甲酸叔丁基酯。

[0122] (16)其它化合物,例如(16.1)1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[2'-(三氟甲基)联苯-2-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(16.2)N-(4'-氯联苯-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(16.3)N-(2',4'-二氯联苯-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(16.4)3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(三氟甲基)联苯-2-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(16.5)N-(2',5'-二氟联苯-2-基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-羧酰胺、(16.6)3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺(如W02004/058723所述)、(16.7)5-氟-1,3-二甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺(如W02004/058723所述)、(16.8)2-氯-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)联苯-2-基]吡啶-3-羧酰胺(如W02004/058723所述)、(16.9)3-(二氟甲基)-N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺(如W02004/058723所述)、(16.10)N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺(如W02004/058723所述)、(16.11)3-(二氟甲基)-N-(4'-乙炔基联苯-2-基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺(如W02004/058723所述)、(16.12)N-(4'-乙炔基联苯-2-基)-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺(如W02004/058723所述)、(16.13)2-氯-N-(4'-乙炔基联苯-2-基)吡啶-3-羧酰胺(如W02004/058723所述)、(16.14)2-氯-N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]吡啶-3-羧酰胺(如W02004/058723所述)、(16.15)4-(二氟甲基)-2-甲基-N-[4'-(三氟甲基)联苯-2-基]-1,3-噻唑-5-羧酰胺(如W02004/058723所述)、(16.16)5-氟-N-[4'-(3-羟基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺(如W02004/058723所述)、(16.17)2-氯-N-[4'-(3-羟基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]吡啶-3-羧酰胺(如W02004/058723所述)、(16.18)3-(二氟甲基)-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺(如W02004/058723所述)、(16.19)5-氟-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺(如W02004/058723所述)、(16.20)2-氯-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]吡啶-3-羧酰胺(如W02004/058723所述)、(16.21)(5-溴-2-甲氧基-4-甲基吡啶-3-基)(2,3,4-三甲氧基-6-甲基苯基)甲酮(如EP-A1559320所述)、(16.22)N-[2-(4-{[3-(4-氯苯基)丙-2-炔-1-基]氧基}-3-甲氧基苯基)乙基]-N2-(甲基磺酰基)缬氨酸(220706-93-4)、(16.23)4-氧代-4-[(2-苯基乙基)氨基]丁酸以及(16.24){6-[(Z)-(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基}氧基]甲基]吡啶-2-基}氨基甲酸丁-3-炔-1-基酯。

[0123] 种类1-16的所有列出的混合配合剂可任选地(如果它们的官能团能够)与合适的碱或酸形成盐。

[0124] 合适的可进行混合的杀细菌剂、杀虫剂、杀螨剂或杀线虫剂的例子可选自下组:

[0125] 杀细菌剂:

[0126] 溴硝醇、双氯酚、三氯甲基吡啶、二甲基二硫代氨基甲酸镍、春雷霉素、辛噻酮、呋喃羧酸、土霉素、噻菌灵、链霉素、叶枯酞、硫酸铜和其它铜制剂。

[0127] 杀虫剂/杀螨剂/杀线虫剂:

[0128] (1)乙酰基胆碱酯酶(AChE)抑制剂,例如:

[0129] 氨基甲酸酯类,如棉铃威、涕灭威、恶虫威、丙硫克百威、丁酮威、丁酮砒威、甲萘威、克百威、丁硫克百威、乙硫苯威、仲丁威、伐虫脒、呋线威、异丙威、甲硫威、灭多威、速灭威、杀线威、抗蚜威、残杀威、硫双威、久效威、唑蚜威、混杀威、XMC、灭杀威;或者

[0130] 有机磷酸酯类,如乙酰甲胺磷、甲基吡恶磷、益棉磷、保棉磷、硫线磷、氯氧磷、毒虫畏、氯甲硫磷、毒死蜱、毒死蜱-甲基、蝇毒磷、杀螟腈、甲基内吸磷、二嗪磷、敌敌畏/DDVP、百治磷、乐果、甲基毒虫畏、乙拌磷、EPN、乙硫磷、灭线磷、伐灭磷、苯线磷、杀螟硫磷、倍硫磷、噻唑磷、庚烯磷、新烟磷(imicyafos)、异柳磷、O-(甲氧基氨基硫基-磷酰基)水杨酸异丙酯、恶唑磷、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、亚砒磷、对硫磷、对硫磷-甲基、稻丰散、甲拌磷、伏杀硫磷、亚胺硫磷、磷胺、辛硫磷、噻啉磷-甲基、丙溴磷、胺丙畏、丙硫磷、吡唑硫磷、哒嗪硫磷、啉硫磷、治螟磷、丁基噻啉磷、双硫磷、特丁硫磷、杀虫畏、甲基乙拌磷、三唑磷、敌百虫和蚜灭磷。

[0131] (2)GABA-门控氯化物通道拮抗剂,例如:

[0132] 环戊二烯有机氯,诸如氯丹和硫丹;或者

[0133] 苯基吡唑(弗普罗),例如乙虫清(ethiprole)和氟虫腈。

[0134] (3)钠通道调节剂/电压依赖性(voltage-dependent)钠通道阻断剂,例如

[0135] 拟除虫菊酯类,例如氟丙菊酯、烯丙菊酯、d-顺式-反式烯丙菊酯、d-反式烯丙菊酯、联苯菊酯、生物烯丙菊酯、生物烯丙菊酯-S-环戊烯基异构体、生物苄呋菊酯、乙氰菊酯、氟氯氰菊酯、β-氟氯氰菊酯、氯氟氰菊酯、λ-氯氟氰菊酯、γ-氯氟氰菊酯、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[(1R)-反式异构体]、溴氰菊酯、右旋烯炔菊酯((EZ)-(1R)-异构体)、S-氰戊菊酯、醚菊酯、甲氰菊酯、氰戊菊酯、氟氰戊菊酯、氟氯苯菊酯、τ-氟胺氰菊酯、苄呋醚(halfenprox)、咪炔菊酯、噻啉菊酯、氯菊酯、苯醚菊酯[(1R)-反式异构体)、右旋炔丙菊酯、除虫菊酯(除虫菊)、苄呋菊酯、氟硅菊酯、七氟菊酯、胺菊酯、胺菊酯[(1R)-异构体]、四溴菊酯和四氟苯菊酯;或者

[0136] DDT或者甲氧滴滴涕。

[0137] (4)烟碱乙酰胆碱受体(nAChR)激动剂,例如:

[0138] 新烟碱类(neonicotinoids),例如啉虫脒、噻虫胺、呋虫胺、吡虫啉、烯啉虫胺、噻虫啉以及噻虫嗪,或者

[0139] 烟碱。

[0140] (5)烟碱乙酰胆碱受体(nAChR)变构激活剂,例如:

[0141] 多杀菌素类(spinosyns),例如斯哌特姆(Spinetoram)和多杀菌素(Spinosad)。

[0142] (6)氯化物通道活化剂,例如:

[0143] 阿弗麦菌素/米尔倍霉素,例如阿巴菌素(Abamectin)、甲氨基阿维菌素-苯甲酸盐、勒皮菌素(Lepimectin)和弥拜菌素。

[0144] (7)保幼激素模拟物,例如

[0145] 保幼激素类似物,例如氢化保幼素(Hydroprene)、丙诺保幼素(Kinoprene)和美赐平(Methoprene);或者

[0146] 苯氧威;或吡丙醚。

- [0147] (8)其它非特异性(多位点)抑制剂,例如:
- [0148] 烷基卤化物,例如甲基溴化物和其它烷基卤化物;或者
- [0149] 三氯硝基甲烷;或磺酰氟;或硼砂;或吐酒石。
- [0150] (9)选择性同翅喂养(feeding)阻断剂,例如吡蚜酮或氟虫酰胺。
- [0151] (10)螨生长抑制剂,例如四螨嗪、噻螨酮和氟螨嗪;或者
- [0152] 乙螨唑。
- [0153] (11)昆虫肠膜的微生物破坏剂,例如苏云金芽孢杆菌苏云金亚种(*Bacillus thuringiensis* subspecies *israelensis*)、球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus*)、苏云金芽孢杆菌艾扎瓦亚种(*Bacillus thuringiensis* subspecies *aizawai*)、苏云金芽孢杆菌库斯塔克亚种(*Bacillus thuringiensis* subspecies *kurstaki*)、苏云金芽孢杆菌泰尼布瑞尼斯亚种(*Bacillus thuringiensis* subspecies *tenebrionis*)、以及BT作物蛋白: Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab1。
- [0154] (12)线粒体ATP合成酶的抑制剂,例如:丁醚脲;或
- [0155] 有机锡杀螨剂,例如三唑锡、三环锡以及苯丁锡;或者
- [0156] 克螨特;或四氯杀螨砒。
- [0157] (13)通过中断质子梯度而实现氧化磷酸化的解偶联剂,例如虫螨腈、DNOC和氟虫胺。
- [0158] (14)烟碱乙酰胆碱受体(nAChR)通道阻断剂,例如杀虫磺、杀螟丹(Cartap hydrochloride)、杀虫环和杀虫双。
- [0159] (15)几丁质生物合成抑制剂(0型),例如双三氟虫脒(Bistrifluron)、氯氟虫脒(Chlorfluazuron)、除虫脒、氟环脒、氟虫脒、氟铃脒、虱螨脒、氟酰脒、多氟虫酰脒(Noviflumuron)、氟苯脒和杀铃脒。
- [0160] (16)几丁质生物合成抑制剂(1型),例如噻嗪酮(Buprofezin)。
- [0161] (17)蜕皮干扰剂,例如灭蝇胺(Cyromazine)。
- [0162] (18)蜕皮激素受体激动剂,例如环虫酰肼、氯虫酰肼、甲氧虫酰肼和虫酰肼。
- [0163] (19)章鱼胺能受体激动剂,例如双甲脒。
- [0164] (20)线粒体复合物III电子转移抑制剂,例如伏蚁脞(Hydramethylnon);灭螨醌;或啞螨酯(Fluacrypyrim)。
- [0165] (21)线粒体复合物I电子转移抑制剂,例如
- [0166] METI杀螨剂,诸如喹螨醚、唑螨酯、啞螨醚、哒螨灵、吡螨胺和唑虫酰胺;或者
- [0167] 鱼藤酮(鱼藤属)。
- [0168] (22)电压依赖性钠通道阻断剂,例如茚虫威或氰氟虫脞(Metaflumizone)。
- [0169] (23)乙酰辅酶A羧化酶抑制剂,例如:
- [0170] 特窗酸或特拉姆酸(tetramic acid)衍生物,诸如季酮螨酯(Spirodiclofen)、螺甲螨酯(Spiromesifen)和螺四胺酸酯(Spirotetramat)。
- [0171] (24)线粒体复合物IV电子转移抑制剂,例如
- [0172] 膦类化合物,例如磷化铝、磷化钙、磷化氢和磷化锌;或者
- [0173] 氰化物。
- [0174] (25)线粒体复合物II电子转移抑制剂,例如赛皮芬(Cyenopyrafen)。

[0175] (28)雷诺定(Ryanodine)受体调节剂,例如

[0176] 二酰胺类,例如氯虫酰胺(Chlorantraniliprole)和氟虫酰胺。

[0177] 具有未知或不确定作用模式的其它活性成分,例如酰胺弗门特(Amidoflumet)、印苦楝子素、苯鲁噻唑(benclothiaz)、苯螨特、联苯肼酯(Bifenazate)、溴螨酯、啉菌酮(Chinomethionat)、冰晶石、氰虫酰胺(Cyantraniliprole)(赛锐皮乐(Cyazypyr))、丁氟螨酯(cyflumetofen)、三氯杀螨醇(dicofol)、氟螨嗪、联氟砒(fluensulfone)、啉虫胺、丁烯氟虫腈(flufiprole)、氟吡菌酰胺、呋喃虫酰肼(fufenozide)、氯噻啉(imidaclothiz)、异菌脲、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、啉虫丙醚、氟虫吡啶(pyrifluquinazon)、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)和碘代甲烷;基于强固芽孢杆菌(*Bacillus firmus*)的其它产品(包括但不限于菌株CNCM I-1582,例如V0TiV0™,BioNem)或以下已知活性化合物中的一种: 3-溴-N-{2-溴-4-氯-6-[(1-环丙基乙基)氨基甲酰基]苯基}-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-羧酰胺(参见W02005/077934)、4-{[(6-溴吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(参见W02007/115644)、4-{[(6-氟吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(参见W02007/115644)、4-{[(2-氯-1,3-噻唑-5-基)甲基](2-氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(参见W02007/115644)、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(参见W02007/115644)、吡啶呋酮(Flupyradifurone)、4-{[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](甲基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(参见W02007/115643)、4-{[(5,6-二氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(参见W02007/115646)、4-{[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](环丙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(参见W02007/115643)、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](环丙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(参见EP-A-0539588)、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](甲基)氨基}呋喃-2(5H)-酮(参见EP-A-0539588)、{[1-(6-氯吡啶-3-基)乙基](甲基)环氧- λ^4 -亚硫烷基(sulfanylidene)}氰胺(参见W02007/149134)及其非对映体{[(1R)-1-(6-氯吡啶-3-基)乙基](甲基)环氧- λ^4 -亚硫烷基}氰胺(A)和{[(1S)-1-(6-氯吡啶-3-基)乙基](甲基)环氧- λ^4 -亚硫烷基}氰胺(B)(也参见W02007/149134),以及杀弗乐(Sulfoxaflo)及其非对映体[(R)-甲基(环氧){(1R)-1-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]乙基}- λ^4 -亚硫烷基}氰胺(A1)和[(S)-甲基(环氧){(1S)-1-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]乙基}- λ^4 -亚硫烷基}氰胺(A2),称作非对映体A的基团(参见W02010/074747、W02010/074751)、[(R)-甲基(环氧){(1S)-1-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]乙基}- λ^4 -亚硫烷基}氰胺(B1)和[(S)-甲基(环氧){(1R)-1-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]乙基}- λ^4 -亚硫烷基}氰胺(B2),称作非对映体B的基团(也参见W02010/074747、W02010/074751)、以及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(参见W02006/089633)、3-(4'-氟-2,4-二甲基联苯基-3-基)-4-羟基-8-氧杂-1-氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(参见W02008/067911)、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(参见W02006/043635)、[(3S,4aR,12R,12aS,12bS)-3-[(环丙基羰基)氧基]-6,12-二羟基-4,12b-二甲基-11-氧代-9-(吡啶-3-基)-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氢-2H,11H-苯并[f]吡喃并[4,3-b]色烯-4-基]甲基环丙烷羧酸酯(参见W02008/066153)、2-氰基-3-(二氟甲氧基)-N,N-二甲基苯磺酰胺(参见W02006/056433)、2-氰基-3-(二氟甲氧基)-N-甲基苯磺酰胺(参见W02006/100288)、2-氰基-3-(二氟甲氧基)-N-乙基苯磺酰胺(参见W02005/035486)、4-(二氟甲氧基)-N-乙基-N-甲基-1,2-苯并噻唑-3-胺1,1-二氧化物(参见

W02007/057407)、N-[1-(2,3-二甲基苯基)-2-(3,5-二甲基苯基)乙基]-4,5-二氢-1,3-噻唑-2-胺(参见W02008/104503)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[呋啉-3,4'-哌啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮(参见W02003/106457)、3-(2,5-二甲基苯基)-4-羟基-8-甲氧基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(参见W02009/049851)、3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙基碳酸酯(参见W02009/049851)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基哌啶-1-基)-5-氟嘧啶(参见W02004/099160)、(2,2,3,3,4,4,5,5-辛氟戊基)(3,3,3-三氟丙基)丙二腈(参见W02005/063094)、(2,2,3,3,4,4,5,5-辛氟戊基)(3,3,4,4,4-五氟丁基)丙二腈(参见W02005/063094)、8-[2-(环丙基甲氧基)-4-(三氟甲基)苯氧基]-3-[6-(三氟甲基)哒嗪-3-基]-3-氮杂双环[3.2.1]辛烷(参见W02007/040280)、氟麦托醌(Flometoquin)、PF1364(CAS-注册号1204776-60-2)(参见JP2010/018586)、5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)苄腈(参见W02007/075459)、5-[5-(2-氯吡啶-4-基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)苄腈(参见W02007/075459)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-{2-氧代-2-[(2,2,2-三氟乙基)氨基]乙基}苯甲酰胺(参见W02005/085216)、4-[[[(6-氯吡啶-3-基)甲基](环丙基)氨基]-1,3-噁唑-2(5H)-酮、4-[[[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)氨基]-1,3-噁唑-2(5H)-酮、4-[[[(6-氯吡啶-3-基)甲基](乙基)氨基]-1,3-噁唑-2(5H)-酮、4-[[[(6-氯吡啶-3-基)甲基](甲基)氨基]-1,3-噁唑-2(5H)-酮(均参见W02010/005692)、NNI-0711(参见W02002/096882)、1-乙酰基-N-[4-(1,1,1,3,3,3-六氟-2-甲氧基丙-2-基)-3-异丁基苯基]-N-异丁酰基-3,5-二甲基-1H-吡啶-4-羧酰胺(参见W02002/096882)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)-5-氯-3-甲基苯甲酰]-2-甲基肼羧酸甲酯(参见W02005/085216)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)-5-氰基-3-甲基苯甲酰]-2-乙基肼羧酸甲酯(参见W02005/085216)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)-5-氰基-3-甲基苯甲酰]-2-甲基肼羧酸甲酯(参见W02005/085216)、2-[3,5-二溴-2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)苯甲酰]-1,2-二乙基肼羧酸甲酯(参见W02005/085216)、2-[3,5-二溴-2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)苯甲酰]-2-乙基肼羧酸甲酯(参见W02005/085216)、(5RS,7RS;5RS,7SR)-1-(6-氯-3-吡啶基甲基)-1,2,3,5,6,7-六氢-7-甲基-8-硝基-5-丙氧基咪唑[1,2-a]吡啶(参见W02007/101369)、2-{6-[2-(5-氟吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]吡啶-2-基}嘧啶(参见W02010/006713)、2-{6-[2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]吡啶-2-基}嘧啶(参见W02010/006713)、1-(3-氯吡啶-2-基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-(甲基氨基甲酰基)苯基]-3-{[5-(三氟甲基)-1H-四唑-1-基]甲基}-1H-吡啶-5-羧酰胺(参见W02010/069502)、1-(3-氯吡啶-2-基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-(甲基氨基甲酰基)苯基]-3-{[5-(三氟甲基)-2H-四唑-2-基]甲基}-1H-吡啶-5-羧酰胺(参见W02010/069502)、N-[2-(叔丁基氨基甲酰基)-4-氰基-6-甲基苯基]-1-(3-氯吡啶-2-基)-3-{[5-(三氟甲基)-1H-四唑-1-基]甲基}-1H-吡啶-5-羧酰胺(参见W02010/069502)、N-[2-(叔丁基氨基甲酰基)-4-氰基-6-甲基苯基]-1-(3-氯吡啶-2-基)-3-{[5-(三氟甲基)-2H-四唑-2-基]甲基}-1H-吡啶-5-羧酰胺(参见W02010/069502)、(1E)-N-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-N'-氰基-N-(2,2-二氟乙基)乙脒(ethanimidamide)(参

见W02008/009360)、N-[2-(5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-羧酰胺(参见CN102057925)以及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]-2-乙基-1-甲基胍羧酸甲酯(参见W02011/049233)。

[0178] 含有其它已知的活性化合物(例如除草剂)或含有肥料、生长调节剂、安全剂或化学信息素的混合物也是可以的。

[0179] 另外,本发明通式(I)的化合物还具有极好的抗真菌活性。它们具有非常广谱的抗真菌作用,特别是抵抗皮肤真菌和芽生真菌(budding fungi)、霉菌和二相真菌(diphasic fungi)(例如抵抗假丝酵母属(*Candida species*),例如白色念珠菌(*Candida albicans*)、光滑假丝酵母(*Candida glabrata*))和絮状表皮霉菌(*Epidermophyton floccosum*)、曲霉属(*Aspergillus species*)例如黑曲霉(*Aspergillus niger*)和烟曲霉(*Aspergillus fumigatus*)、毛癣菌属(*Trichophyton species*)例如须癣毛癣菌(*Trichophyton mentagrophytes*)、小孢子菌属(*Microsporon species*)例如犬小芽孢菌(*Microsporon canis*)和奥杜盎小孢子菌(*audouinii*)。列举这些真菌并非限制可控制的霉菌范围,而是仅以说明的方式提供这些真菌。

[0180] 本发明的通式(I)的化合物和杀真菌组合物可用于治疗性或预防性地控制植物或作物的植物病原真菌。

[0181] 因此,依据本发明的另一方面,本发明还提供了一种治疗性或预防性地控制植物或农作物植物病原真菌的方法,该方法的特征在于将本发明的通式(I)的化合物或杀真菌组合物施用到种子、植物或植物的果实或者正在生长或需要生长植物的土壤中。

[0182] 本发明的处理方法还可用于处理繁殖材料(如块茎或根茎等),以及种子、幼苗或移植幼苗以及植物或移植植物。该处理方法也可用于处理根。本发明的处理方法也可用于处理植物的地上部分如有关植物的干、茎或梗、叶子、花和果实。

[0183] 依据本发明,可处理所有植物和植物部分。植物是指所有的植物和植物群体,例如优良(desirable)和不良(undesirable)野生植物、培育植物和植物品种(无论是否被植物品种或植物培育者权利保护)。培育植物和植物品种可为通过常规繁殖和育种方法获得的植物,所述方法可由一种或多种以下生物技术方法来辅助或补充,例如:通过使用双单倍体、原生质体融合、随机和定向诱变、分子或遗传标记或利用生物工程和遗传工程方法。“植物部分”是指所有地上和地下部分以及植物的器官,例如芽、叶、花和根,其中列出例如叶、针状叶、茎干、树干、花、果实体、果实和种子以及根、球茎和根状茎。作物以及无性和有性繁殖材料(例如插枝、球茎、根状茎、长匐茎和种子)也属于植物部分。

[0184] 在可通过本发明方法保护的植物中,可包括主要农作物,诸如玉米、大豆、棉花、芸苔属油籽(*Brassica oilseeds*),例如甘蓝型油菜(*Brassica napus*)(例如柯罗纳(*canola*)),芜菁(*Brassica rapa*),褐芥菜(*B. juncea*)(例如芥末)和埃塞俄比亚芥(*Brassica carinata*)、稻、小麦、甜菜、甘蔗、燕麦、黑麦、大麦、小米、黑小麦、亚麻、葡萄树和具有以下各种植物类群的各种水果和蔬菜,例如蔷薇科(*Rosaceae sp.*)(例如,仁果类水果,如苹果和梨,还有核果,诸如杏、樱桃、扁桃和桃子,浆果类,诸如草莓)、茶藨子科(*Ribesioideae sp.*)、胡桃科(*Juglandaceae sp.*)、桦木科(*Betulaceae sp.*)、漆树科(*Anacardiaceae sp.*)、山毛榉科(*Fagaceae sp.*)、桑科(*Moraceae sp.*)、木犀科(*Oleaceae*

sp.)、猕猴桃科(Actinidaceae sp.)、樟科(Lauraceae sp.)、芭蕉科(Musaceae sp.) (例如香蕉树和种植物)、茜草科(Rubiaceae sp.) (例如咖啡豆)、山茶科(Theaceae sp.)、梧桐科(Sterculiaceae sp.)、芸香科(Rutaceae sp.) (例如柠檬、橙子和葡萄柚);茄科(Solanaceae sp.) (例如,西红柿、土豆、辣椒、茄子)、百合科(Liliaceae sp.)、菊科(Compositiae sp.) (例如莴苣、朝鲜蓟和菊苣,包括根菊苣、苦苣和常见菊苣)、伞形科(Umbelliferae sp.) (例如胡萝卜、香菜、芹菜和块根芹)、葫芦科(Cucurbitaceae sp.) (例如黄瓜,包括腌黄瓜、南瓜,西瓜,葫芦和蜜瓜)、葱科(Alliaceae sp.) (例如洋葱和韭菜)、十字花科(Cruciferae sp.) (例如白球甘蓝、红球甘蓝、西兰花、菜花、抱子甘蓝、小唐菜、甘蓝、萝卜、辣根、水芹、大白菜)、豆科(Leguminosae sp.) (例如花生、豌豆和豆类,例如攀爬豆类(climbing beans)和蚕豆)、藜科(Chenopodiaceae sp.) (例如饲用甜菜(mangold)、苕荳菜(spinach beet)、菠菜、甜菜根);锦葵科(Malvaceae) (例如秋葵)、天门冬科(Asparagaceae) (例如芦笋)、园艺作物和森林作物;观赏植物;以及这些作物的遗传改进的同系物。

[0185] 本发明的处理方法可用于处理经遗传改进的有机体(GMOs),例如植物或种子。经遗传改进的植物(或转基因植物)是其中异源基因已经稳定地整合入基因组中的植物。术语“异源基因”主要是指如下基因,其在植物外部提供或组装并且当被引入细胞核、叶绿体或线粒体基因组中时,通过表达相关的蛋白质或多肽或通过下调植物中存在的其它基因或者使得所述其它基因沉默(使用例如反义技术、共抑制技术或RNA干扰-RNAi-技术)来赋予经转化的植物新的或改进的农艺性质或其它性质。位于基因组中的异源基因也称作转基因。植物基因组中由特定位置定义的转基因称作转化或转基因事件。

[0186] 根据植物物种或植物品种、其位置和生长条件(土壤、气候、生长期、营养),本发明的处理还可产生超叠加(“协同”)效果。因此,例如,减少施用比率和/或拓宽活性范围和/或增加根据本发明可使用的活性化合物和组合物的活性、植物生长更好、对高温或低温的耐受性增加、对干旱或对水或土壤含盐量的耐受性提高、开花性能提高、收获更容易、成熟加速、收获产量更高、果实更大、植物高度更高、叶子颜色更绿、开花更早、收获的产物的品质更高和/或营养价值更高、果实中的糖浓度更高、收获的产物的储存稳定性和/或加工性能更好,上述都是可能的,其超过实际预期的效果。

[0187] 在某些施用比率下,本发明的活性化合物组合还可在植物中具有强化效果。因此,它们还可适用于调动植物防御系统抵抗不希望的微生物的攻击。这可能(如果合适)是本发明组合增强活性(例如抵抗真菌)的原因之一。在本申请上下文中,植物加强(抗性诱导)物质应理解为是指能以某种方式刺激植物的防御系统从而在随后被不利的微生物接种时经过处理的植物对这些不利的微生物表现出明显的抵抗性的物质或物质的组合。在此情况中,不利的微生物应理解为是指植物病原真菌、细菌和病毒。因此,本发明的物质可用于保护植物,使其在经过处理后的一段时间内能抵抗上述病原体的攻击。在使用活性化合物处理植物后,实现保护的这段时间通常为1-10天,较好为1-7天。

[0188] 本发明较好的待处理的植物和植物品种包括具有赋予这些植物特别有利的有用特征的遗传材料(无论通过育种和/或生物技术方式获得)的所有植物。

[0189] 本发明较好的待处理的植物和植物品种还可抵抗一种或多种生物胁迫,即所述植物对如下的动物和微生物有害物显示出较好的防御,例如线虫、昆虫、螨虫、植物病原真菌、

细菌、病毒和/或类病毒。

[0190] 抗线虫植物的例子如例如美国专利申请第11/765,491、11/765,494、10/926,819、10/782,020、12/032,479、10/783,417、10/782,096、11/657,964、12/192,904、11/396,808、12/166,253、12/166,239、12/166,124、12/166,209、11/762,886、12/364,335、11/763,947、12/252,453、12/209,354、12/491,396或12/497,221号中所述。

[0191] 本发明的待处理的植物和植物品种还可为抵抗一种或多种非生物胁迫的植物。非生物胁迫条件可包括,例如,干旱、冷温暴露、热暴露、渗透胁迫、水淹、土壤盐度增加、矿物质暴露增加、臭氧暴露、强光暴露、限制性供应氮营养素、限制性供应磷营养素、避阴。

[0192] 本发明的待处理的植物和植物品种还可为其特征在于产量有所增加的植物。所述植物的产量有所增加的原因可为,例如,改进植物生理学、生长和发育(例如用水效率、保水效率)、改进氮使用、增强碳同化、改进光合作用、提高发芽效率和加速成熟。产量还可受改进的植物结构(在胁迫和非胁迫条件下)影响,包括但不限于,提早开花、对杂交种子生产的开花控制,幼苗活力、植物大小、节间数量及距离、根生长、种子大小、果实大小、豆荚大小、豆荚或穗数量、每穗或豆荚的种子数量、种子质量、提高种子填充、减少种子分散、减少豆荚开裂和耐倒伏性。其它产量特性包括种子组成,例如碳水化合物含量、蛋白质含量、油含量及组成、营养价值、减少抗营养化合物、改进加工性和更好的储存稳定性。

[0193] 具有上述特质的植物的例子罗列但不限于表A中。

[0194] 本发明可处理的植物是如下的杂交植物,其已经表达出杂种优势或杂交活力的特征,从而通常得到更高产量、活力、健康和对生物和非生物胁迫的抗性。这些植物通常通过近交雄性不育亲本(雌性亲本)与另一近交雄性可育亲本(雄性亲本)杂交获得。杂交种子通常从雄性不育植物收获并出售给种植者。雄性不育植物有时可(例如在玉米中)通过去除雄性产生,即机械去除雄性生殖器官(或雄花),但更通常地,雄性不育是由植物基因组中的遗传决定簇产生。在这种情况下,以及特别是当种子是从杂交植物收获的所需产物时,其通常用于确保杂交植物中的雄性能育性得以完全恢复。这可通过确保雄性亲本具有合适的能育性恢复基因来实现,所述能育性恢复基因能够恢复包含造成雄性不育的遗传决定簇的杂交植物中的雄性能育性。雄性不育的遗传决定簇可位于细胞质中。例如,芸苔属物种(W092/05251、W095/09910、W098/27806、W005/002324、W006/021972和US6,229,072)中描述了细胞质的雄性不育(CMS)的例子。然而,雄性不育的遗传决定簇也可位于细胞核基因组中。雄性不育植物也可由植物生物技术方法(例如基因工程)获得。W089/10396中描述了获得雄性不育植物的特别有用的方法,其中,例如核糖核酸酶(例如芽孢杆菌RNA酶)选择性在雄蕊的绒毡层细胞中表达。然后能育性可通过在绒毡层细胞中表达核糖核酸酶抑制剂(例如芽孢杆菌RNA酶抑制剂)来得到恢复(例如W091/02069)。

[0195] 本发明可处理的植物或植物品种(由植物生物技术方法获得,例如通过基因工程获得)是除草剂耐受植物,即对一种或多种给定的除草剂具有耐受性的植物。这些植物可通过遗传转化,或通过选择包含赋予该除草剂耐受性的突变的植物获得。

[0196] 抗除草剂植物是例如耐草甘膦植物,即对除草剂草甘膦或其盐具有耐受性的植物。可通过不同的方法使植物对草甘膦具有耐受性。例如,耐草甘膦植物可通过转化具有编码5-烯醇丙酮酰莽草酸-3-磷酸合酶(EPSPS)的基因的植物来获得。这些EPSPS基因的例子是鼠伤寒沙门菌(*Salmonella typhimurium*)的AroA基因(突变CT7)(Comai等,科学

(Science)(1983),221,370-371)、农杆菌(*Agrobacterium* sp.)的CP4基因(Barry等, Curr.Topics Plant Physiol.(1992),7,139-145)、编码牵牛花EPSPS的基因(Shah等,科学(Science)(1986),233,478-481)、编码番茄EPSPS的基因(Gasser等, J.Biol.Chem.(1988) 263,4280-4289)、或编码牛筋草(*Eleusine*)EPSPS的基因(W001/66704)。还可为突变的EPSPS,如例如EP0837944、W000/66746、W000/66747或W002/26995中所述。耐草甘膦植物还可通过表达编码草甘膦氧化还原酶的基因来获得,如美国专利第5,776,760和5,463,175号中所述。耐草甘膦植物还可通过表达编码草甘膦乙酰基转移酶的基因来获得,如例如W002/36782、W003/092360、W005/012515和W007/024782中所述。耐草甘膦植物还可通过选择包含天然产生的上述基因突变体的植物来获得,如例如W001/024615或W003/013226中所述。具有草甘膦耐受性的表达EPSPS基因的植物如例如美国专利申请第11/517,991、10/739,610、12/139,408、12/352,532、11/312,866、11/315,678、12/421,292、11/400,598、11/651,752、11/681,285、11/605,824、12/468,205、11/760,570、11/762,526、11/769,327、11/769,255、11/943801或12/362,774号中所述。具有草甘膦耐受性的含其它基因(例如脱羧酶基因)的植物如例如美国专利申请11/588,811、11/185,342、12/364,724、11/185,560或12/423,926中所述。

[0197] 其它耐除草剂植物是例如对抑制酶谷氨酰胺合成酶的除草剂(例如双丙氨磷、草胺磷或草丁膦)有耐受性的植物。这些植物可通过表达解除所述除草剂的毒性或抵抗抑制的突变谷氨酰胺合成酶来获得,例如如美国专利申请第11/760,602号所述。一种此类有效的解毒酶是一种编码草胺磷乙酰基转移酶的酶(例如链霉菌属(*Streptomyces*)物种的bar或pat蛋白)。表达外源草胺磷乙酰基转移酶的植物如例如美国专利第5,561,236、5,648,477、5,646,024、5,273,894、5,637,489、5,276,268、5,739,082、5,908,810和7,112,665中所述。

[0198] 其它耐除草剂植物还是对抑制羟基苯基丙酮酸双氧化酶(HPPD)的除草剂具有耐受性的植物。羟基苯基丙酮酸双氧化酶是催化将对-羟基苯丙酮酸(HPP)转化成尿黑酸盐的反应的酶。耐HPPD-抑制剂的植物可使用编码天然产生的抗HPPD酶的基因,或编码突变或嵌合HPPD酶的基因来转化,如W096/38567、W099/24585、W099/24586、W02009/144079、W02002/046387或US6,768,044中所述。耐HPPD抑制剂还可通过用编码某些能够形成尿黑酸盐的酶的基因转化植物来获得,尽管HPPD抑制剂可抑制天然HPPD酶。W099/34008和W002/36787中描述了此类植物和基因。植物对耐HPPD抑制剂的耐受性还可通过使用编码具有预苯酸盐脱氢酶(PDH)活性的酶的基因(除了使用编码耐HPPD酶的基因外)转化植物来改进,如W02004/024928中所述。另外,如W02007/103567和W02008/150473中所述,通过向其基因组添加编码能够代谢或降解HPPD抑制剂的酶(例如CYP450酶)的基因可使植物对HPPD抑制剂除草剂更耐受。

[0199] 其它除草剂抗性植物是对乙酰乳酸合酶(ALS)抑制剂具有耐受性的植物。已知ALS抑制剂包括,例如磺酰脲、咪唑并噻酮、三唑并嘧啶、嘧啶氧基(硫基)苯甲酸酯/盐、和/或磺酰基氨基羰基三唑并噻酮除草剂。已知ALS酶(也称作乙酰羟基酸合酶,AHAS)中的不同突变会赋予对不同除草剂和除草剂基团的耐受性,如例如Tranel和Wright, Weed Science(2002), 50,700-712,以及美国专利第5,605,011、5,378,824、5,141,870和5,013,659号中所述。耐磺酰脲植物和耐咪唑并噻酮植物的生产如美国专利第5,605,011、5,013,659、5,141,870、

5,767,361、5,731,180、5,304,732、4,761,373、5,331,107、5,928,937和5,378,824号、以及国际公开W096/33270中所述。其它耐咪唑并喹啉酮的植物还如例如W02004/040012、W02004/106529、W02005/020673、W02005/093093、W02006/007373、W02006/015376、W02006/024351和W02006/060634中所述。其它耐磺酰脲和耐咪唑并喹啉酮的植物还如(例如)W007/024782和美国专利申请第61/288958号中所述。

[0200] 其它耐咪唑并喹啉酮和/或磺酰脲的植物可通过诱导突变、在存在除草剂的情况下选择细胞培养物、或突变育种来获得,如(例如)美国专利5,084,082(对于大豆)、W097/41218(对于水稻)、美国专利5,773,702和W099/057965(对于甜菜)、美国专利5,198,599(对于莴苣)、或W001/065922(对于向日葵)中所述。

[0201] 本发明还可处理的植物或植物品种(由植物生物技术方法获得,例如基因工程)是昆虫抗性转基因植物,即抵抗某些目标昆虫的攻击的植物。这些植物可通过遗传转化,或通过选择包含赋予该昆虫抗性的突变的植物来获得。

[0202] 本文中所述的“昆虫抗性转基因植物”包括任意含有至少一种转基因的植物,所述转基因包括选自下组编码的编码序列:

[0203] 1)来自苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*)的杀虫晶体蛋白或其杀虫部分,例如Crickmore等(,微生物学和分子生物学综述(1998, *Microbiology and Molecular Biology Reviews*, 62, 807-813)列出的杀虫晶体蛋白, Crickmore等(2005)对苏云金芽孢杆菌毒素命名进行了更新,见http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/),或其杀虫部分,例如Cry蛋白类的蛋白Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1B、Cry1C、Cry1D、Cry1F、Cry2Ab、Cry3Aa或Cry3Bb或其杀虫部分(例如EP1999141和W02007/107302),或者被合成基因编码的这类蛋白,例如参见美国专利申请12/249,016;或

[0204] 2)来自苏云金芽孢杆菌的晶体蛋白或其部分,该晶体蛋白或其部分在来自苏云金芽孢杆菌的第二其它晶体蛋白或其部分存在下具有杀虫性,例如由Cry34和Cry35晶体蛋白组成的二元毒素(Moellenbeck等人,自然生物技术(*Nat. Biotechnol.*)(2001), 19, 668-72; Schnepf等人, *Applied Environm. Microbiol.* (2006), 71, 1765-1774),或由Cry1A或Cry1F蛋白和Cry2Aa或Cry2Ab或Cry2Ae蛋白组成的二元毒素(美国专利申请第12/214,022号和EP08010791.5);或

[0205] 3)包含来自苏云金芽孢杆菌的不同杀虫晶体蛋白部分的杂交杀虫蛋白,例如上述1)的蛋白的杂交体或上述2)的蛋白的杂交体,例如由玉米事件MON89034产生的Cry1A.105蛋白(W02007/027777);或

[0206] 4)上述1)至3)中的任意一种蛋白,其中一些(较好为1-10)氨基酸被另一种氨基酸代替以获得对目标昆虫物种的更高杀虫活性,和/或扩展受影响的目标昆虫物种的范围,和/或由于在克隆或转化过程中在编码DNA中引入的变化,例如玉米事件MON863或MON88017中的Cry3Bb1蛋白,或玉米事件MIR604中的Cry3A蛋白;或

[0207] 5)来自苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*)或蜡样芽孢杆菌(*Bacillus cereus*)的杀虫分泌蛋白,或其杀虫部分,例如在http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html中所列的营养期杀虫(VIP)蛋白,例如来自VIP3Aa蛋白类的蛋白;或

[0208] 6)来自苏云金芽孢杆菌或蜡样芽孢杆菌的分泌蛋白,该蛋白在来自苏云金芽孢杆

菌或蜡样芽孢杆菌的第二分泌蛋白存在下具有杀虫性,例如由VIP1A和VIP2A蛋白组成的二元毒素(W094/21795);或

[0209] 7)包含来自苏云金芽孢杆菌或蜡样芽孢杆菌的不同分泌蛋白部分的杂交杀虫蛋白,例如上述1)中蛋白的杂交体或上述2)中蛋白的杂交体;或

[0210] 8)上述5)至7)中的任意一种蛋白,其中一些(较好为1-10)氨基酸被另一种氨基酸代替以获得对目标昆虫物种的更高杀虫活性,和/或扩展受影响的目标昆虫物种的范围,和/或由于在克隆或转化过程中在编码DNA中引入的变化(同时仍编码杀虫蛋白),例如玉米事件COT102中的VIP3Aa蛋白;或

[0211] 9)来自苏云金芽孢杆菌或蜡样芽孢杆菌的分泌蛋白,该蛋白在来自苏云金芽孢杆菌的晶体蛋白存在下具有杀虫性,例如由VIP3和Cry1A或Cry1F组成的二元毒素(美国专利申请第61/126083和61/195019号),或由VIP3蛋白和Cry2Aa或Cry2Ab或Cry2Ae蛋白组成的二元毒素(美国专利申请第12/214,022号和EP08010791.5)。

[0212] 10)上述9)的一种蛋白,其中一些(较好为1-10)氨基酸被另一种氨基酸代替以获得对目标昆虫物种的更高杀虫活性,和/或扩展受影响的目标昆虫物种的范围,和/或由于在克隆或转化过程中在编码DNA中引入的变化(同时仍编码杀虫蛋白)。

[0213] 当然,本文中所用的昆虫抗性转基因植物,还包括包含编码上述1-10类中任一种蛋白的基因的组的任意植物。在一种实施方式中,昆虫抗性植物包含一种以上编码上述1-10类中的任一种蛋白的转基因,从而在使用针对不同目标昆虫物种的不同蛋白时扩展受影响的目标昆虫物种的范围,或通过使用对相同目标昆虫物种具有杀虫性但具有不同作用模式(例如在昆虫中结合不同的受体结合位点)的不同蛋白来延迟植物的昆虫抗性发展。

[0214] 本文中所用的“昆虫抗性转基因植物”还包括含有至少一种转基因的任何植物,所述转基因包含表达后产生双链RNA的序列,该序列在被植物虫害摄取后能抑制该植物虫害的生长,例如参见W02007/080126、W02006/129204、W02007/074405、W02007/080127和W02007/035650。

[0215] 本发明还可处理的植物或植物品种(由植物生物技术方法获得,例如基因工程)可耐受非生物胁迫。这些植物可通过遗传转化,或通过选择包含赋予该胁迫抗性的突变的植物来获得。特别有用的胁迫耐受性植物包括:

[0216] 1)包含能够减少植物细胞或植物中多聚(ADP-核糖)聚合酶(PARP)基因的表达和/或活性的转基因的植物,如W000/04173、W0/2006/045633、EP04077984.5或EP06009836.5中所述。

[0217] 2)包含可增强能够减少植物或植物细胞中的PARC编码基因的表达和/或活性的转基因的胁迫耐受性的植物,如(例如)W02004/090140中所述。

[0218] 3)含有一种抗胁迫增强转基因的植物,该转基因编码烟酰胺腺嘌呤二核苷酸补救合成路径的植物功能酶,该酶包括烟酰胺酶,烟酰胺磷酸核糖基转移酶,烟酸单核苷酸磷酸腺苷转移酶、烟酰胺腺嘌呤二核苷酸合成酶或烟酰胺磷酸核糖基转移酶,如EP04077624.7, W02006/133827, PCT/EP07/002433, EP1999263或W02007/107326。

[0219] 本发明还可处理的植物或植物品种(由植物生物技术方法获得,例如基因工程)显示出改变了所收获的产品数量、品质和/或储存稳定性,和/或改变了所收获的产品具体成分的性质,例如:

[0220] 1)合成改性的淀粉的转基因植物,其物理化学性质、尤其是直链淀粉含量或直链淀粉/支链淀粉比、支化程度、平均链长、侧链分布、粘度行为、胶凝强度、淀粉颗粒尺寸和/或淀粉颗粒形貌,与野生型植物细胞或植物中的合成淀粉相比有所改变,从而其更适合于具体的应用。所述合成改性淀粉的转基因植物在以下文献中公开:例如EP0571427、W095/04826、EP0719338、W096/15248、W096/19581、W096/27674、W097/11188、W097/26362、W097/32985、W097/42328、W097/44472、W097/45545、W098/27212、W098/40503、W099/58688、W099/58690、W099/58654、W000/08184、W000/08185、W000/08175、W000/28052、W000/77229、W001/12782、W001/12826、W002/101059、W003/071860、W02004/056999、W02005/030942、W02005/030941、W02005/095632、W02005/095617、W02005/095619、W02005/095618、W02005/123927、W02006/018319、W02006/103107、W02006/108702、W02007/009823、W000/22140、W02006/063862、W02006/072603、W002/034923、EP06090134.5、EP06090228.5、EP06090227.7、EP07090007.1、EP07090009.7、W001/14569、W002/79410、W003/33540、W02004/078983、W001/19975、W095/26407、W096/34968、W098/20145、W099/12950、W099/66050、W099/53072、US6,734,341、W000/11192、W098/22604、W098/32326、W001/98509、W001/98509、W02005/002359、US5,824,790、US6,013,861、W094/04693、W094/09144、W094/11520、W095/35026、W097/20936。

[0221] 2)合成非淀粉碳水化合物聚合物的转基因植物,或与未经过遗传修饰的野生型植物相比具有改变的性质的合成非淀粉碳水化合物聚合物的转基因植物。例子是产生多聚果糖(尤其是菊糖和果聚糖类型)的植物(如EP0663956、W096/01904、W096/21023、W098/39460和W099/24593中所揭示);产生 α -1,4-葡聚糖的植物(如W095/31553、US2002031826、US6,284,479、US5,712,107、W097/47806、W097/47807、W097/47808和W000/14249中所揭示);产生 α -1,6-支化 α -1,4-葡聚糖的植物(如W000/73422中所揭示);产生阿塔娜(alternan)的植物(如W000/47727、W000/73422、EP06077301.7、US5,908,975和EP0728213中所揭示);

[0222] 3)产生透明质酸的转基因植物,如例如W02006/032538、W02007/039314、W02007/039315、W02007/039316、JP2006304779、及W02005/012529中所揭示。

[0223] 4)转基因植物或杂交植物,例如具有以下特性的洋葱,所述特性诸如“高可溶性固体含量”、“低刺激性”(LP)和/或“储存时间长”(LS),如美国专利申请第12/020,360和61/054,026号中所述。

[0224] 本发明还可处理的植物或植物品种(由植物生物技术方法获得,例如基因工程)是具有改变的纤维特性的植物,例如棉花植物。这些植物可通过遗传转化,或通过选择包含赋予该改变的纤维特性的突变的植物来获得,包括:

[0225] a)包含改变形式的纤维素合酶基因的的植物,例如棉花植物,如W098/00549中所述

[0226] b)包含改变形式的rsw2或rsw3同源核酸的植物,例如棉花植物,如W02004/053219中所述

[0227] c)具有增加蔗糖磷酸合酶的表达的的植物,例如棉花植物,如W001/17333中所述

[0228] d)具有增加蔗糖合酶的表达的的植物,例如棉花植物,如W002/45485中所述

[0229] e)植物,例如棉花植物,其中在纤维状细胞基础上的胞间连丝的定时改变,例如通过下调纤维选择性 β -1,3-葡聚糖酶来实现,如W02005/017157中所述,或如EP08075514.3或美国专利申请第61/128,938号所述。

[0230] f)具有改变的纤维反应性(例如通过表达包含nodC的N-乙酰基葡萄糖胺转化酶基因和几丁质合成酶(chitin synthase)基因)的植物,例如棉花植物,如W02006/136351中所述。

[0231] 本发明还可处理的植物或植物品种(由植物生物技术方法获得,例如基因工程)是具有改变的油分布(oil profile)性质的植物,例如油菜或相关芸苔属植物。这类植物可通过遗传转化或通过选择含有赋予这种改变的分布的突变的植物来获得,这类植物包括:

[0232] a)产生具有高油酸含量的油的植物,例如油菜植物,如例如US5,969,169、US5,840,946或US6,323,392或US6,063,947中所述

[0233] b)产生具有低亚油酸含量的油的植物,例如油菜植物,如US6,270,828、US6,169,190或US5,965,755中所述

[0234] c)产生具有低水平饱和脂肪酸的油的植物,例如油菜植物,如例如美国专利第5,434,283号或美国专利申请第12/668303号中所述。

[0235] 还可根据本发明处理的植物或植物品种(由植物生物技术方法获得,例如基因工程)是具有改变的落粒性的植物,例如油籽油菜(oilseed rape)或相关芸苔属植物。这类植物可通过遗传转化或通过选择含有赋予这种改变的落粒性的突变的植物来获得,并且这类植物包括诸如具有延迟的或降低的落粒性的油籽油菜的植物,如美国专利申请第61/135,230号、W009/068313和W010/006732中所述。

[0236] 可依据本发明处理的特别有用的转基因植物是含转化事件或转化事件组合的植物,它们是向美国农业部(USDA)动植物卫生检验局(APHIS)提交的要求在美国非管制身份的请求的主题,无论这些请求被准予或仍然处在待审中。在任何时候,该信息很容易从APHIS(4700 River Road Riverdale, MD 20737, USA)获得,例如在其互联网站上(URL http://www.aphis.usda.gov/brs/not_reg.html)。截止到本申请的提交日,被APHIS审理中或被APHIS准予的要求非管制身份的请求是表B所列的那些,包括以下信息:

[0237] -请求(Petition):请求的识别号。转化事件的技术描述可在各请求文件中找到,而这些请求文件可根据该请求号从APHIS得到,例如从APHIS网站上获得。这些描述通过参考结合于此。

[0238] -请求的延伸(Extension of Petition):对之前的请求要求延伸。

[0239] -机构(Institution):提交请求的实体的名称。

[0240] -管制项目(Regulated article):涉及的植物物种。

[0241] -转基因表型(Transgenic phenotype):通过转化事件赋予植物的特性。

[0242] -转化事件或系(Transformation event or line):要求非管制身份的一个或多个事件(有时称为一个或多个系)的名称。

[0243] -APHIS文档:与请求相关的APHIS出版的各种文件,它们可以是APHIS要求的。

[0244] 其它特别有用的含单个转化事件或转化事件组合的植物例如在各个国家或地方性管理机构的数据库中列出(参见,例如http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx和<http://www.agbios.com/dbase.php>)。

[0245] 更特别地,转基因植物包括在农学上中立或有益的位置含有转基因的植物,例如表C中所列的任何专利文献中所述。

[0246] 表A

特征	参考文献	
[0247]	用水效率	WO 2000/073475
	用氮效率	WO 1995/009911 WO 2007/076115
		WO 1997/030163 WO 2005/103270
		WO 2007/092704 WO 2002/002776
[0248]	改进的光合作用	WO 2008/056915 WO 2004/101751
	抗线虫性	WO 1995/020669 WO 2003/033651
		WO 2001/051627 WO 1999/060141
		WO 2008/139334 WO 1998/012335
		WO 2008/095972 WO 1996/030517
		WO 2006/085966 WO 1993/018170
	降低的豆荚开裂性	WO 2006/009649 WO 1997/013865
		WO 2004/113542 WO 1996/030529
		WO 1999/015680 WO 1994/023043
		WO 1999/000502
	抗蚜虫性	WO 2006/125065 WO 2008/067043
		WO 1997/046080 WO 2004/072109
	抗核盘菌属性	WO 2006/135717 WO 2005/000007
		WO 2006/055851 WO 2002/099385
		WO 2005/090578 WO 2002/061043
	抗葡萄孢属性	WO 2006/046861 WO 2002/085105
[0249]	抗盘梗霉属性	US 20070022496 WO 2004/049786
		WO 2000/063432
	抗欧文菌属性	WO 2004/049786
	抗长线形病毒组性	WO 2007/073167 WO 2002/022836
	(Closterovirus resistance)	WO 2007/053015
	应激耐受性(包括耐旱性)	WO 2010/019838 WO2008/002480
[0251]		WO 2009/049110 WO2005/033318
	抗草花叶病毒组性	WO 2006/038794
[0249]	表B	
[0250]	到2010年3月31日APHIS准予的或在审的要求非管制身份的请求	
[0251]	注:若要获得最新的不再受管制的作物的列表,请察看目前请求状况(Current Status of Petitions)。	
[0252]	该列表是自动更新的,反映目前APHIS收到的所有请求,包括在审、撤回或准予的请求。	
[0253]	缩写:	
[0254]	CMV-黄瓜花叶病病毒; CPB-科罗拉多马铃薯甲虫; PLRV-马铃薯卷叶病毒;	
[0255]	PRSV-番木瓜环斑病毒; PVY-马铃薯Y病毒; WMV2-西瓜花叶病毒2	
[0256]	ZYMV-西葫芦黄花叶病毒	
[0257]		

在审的非管制身份的请求					
申请文件					
请求	请求号延伸 ***	机构	管制项目	转基因表型	转化事件或系
10-070-01p		弗吉尼亚理工大学(Virginia Tech)	花生	耐受核盘菌属枯萎病(Sclerotinia blight resistant)	N70, P39, 和 W171

[0258]

09-349-01p		陶氏益农(Dow AgroSciences)	大豆	耐受除草剂	DAS-68416-4
09-328-01p		拜尔农科(Bayer Crop Science)	大豆	耐受除草剂	FG72
09-233-01p		陶氏(Dow)	玉米	耐受除草剂	DAS-40278-9
09-201-01p		孟山都(Monsanto)	大豆		MON-87705-6
09-183-01p		孟山都(Monsanto)	大豆		MON-87769
09-082-01p		孟山都(Monsanto)	大豆	耐受鳞翅类(Lepidopteran resistant)	MON 87701
09-063-01p		史坦恩种子(Stine Seed)	玉米	耐受草甘膦(Glyphosate tolerant)	HCEM485
09-055-01p		孟山都(Monsanto)	玉米	耐旱(Drought Tolerant)	MON 87460
09-015-01p		巴斯孚植物科学公司(BASF Plant Science, LLC)	大豆	耐受除草剂	BPS-CV127-9 大豆
08-366-01p		阿伯基(ArborGen)	桉树	耐冻(Freeze Tolerant), 改变繁殖力(Fertility Altered)	ARB-FTE1-08
08-340-01p		拜尔(Bayer)	棉花	耐受草铵膦(Glufosinate Tolerant), 抗虫(Insect Resistant)	T304-40XGHB119
08-338-01p		先锋(Pioneer)	玉米	雄性不育(Male Sterile), 恢复繁殖力(Fertility Restored), 视觉标记(Visual Marker)	DP-32138-1
08-315-01p		弗洛丽金(Florigene)	玫瑰	改变花色(Altered Flower Color)	IFD-52401-4 和 IFD-52901-9
07-253-01p		先正达(Syngenta)	玉米	耐受鳞翅类	MIR-162 玉米
07-108-01p		先正达(Syngenta)	棉花	耐受鳞翅类	COT67B
06-354-01p		先锋(Pioneer)	大豆	高油酸(High Oleic Acid)	DP-305423-1
05-280-01p		先正达(Syngenta)	玉米	耐热的 α 淀粉酶(Thermostable alpha-amylase)	3272
04-110-01p		MF 基因(Monsanto & Forage Genetics)	苜蓿(Alfalfa)	耐受草甘膦	J101, J163

[0259]

03-104-01p		孟山都-斯科兹 (Monsanto & Scotts)	匍匐翦股 颖 (Creeping bentgrass)	耐受草甘膦	ASR368
------------	--	-----------------------------------	--------------------------------------	-------	--------

[0260] 准予的非管制身份的请求

[0261]

申请文件					
请求	请求号延伸 ***	机构	管制项目	转基因表型	转化事件或系
07-152-01p		先锋(Pioneer)	玉米	耐草甘膦和咪唑啉酮(glyphosate & Imidazolinone tolerant)	DP-098140-6
04-337-01p		佛罗里达大学 (University of Florida)	木瓜	耐受番木瓜环斑病毒(Papaya Ringspot Virus Resistant)	X17-2
06-332-01p		拜尔农科(Bayer CropScience)	棉花	耐受草甘膦	GHB614
06-298-01p		孟山都 (Monsanto)	玉米	耐受欧洲玉米螟 (European Corn Borer resistant)	MON 89034
06-271-01p		先锋(Pioneer)	大豆	耐受草甘膦 和 乙酰乳酸合酶 (glyphosate & acetolactate synthase tolerant)	356043 (DP-356043-5)
06-234-01p	98-329-01p	拜尔农科(Bayer CropScience)	稻	耐受草胺膦 (Phosphinothricin tolerant)	LLRICE601
06-178-01p		孟山都 (Monsanto)	大豆	耐受草甘膦	MON 89788
04-362-01p		先正达 (Syngenta)	玉米	保护玉米食根昆虫 (Corn Rootworm Protected)	MIR604
04-264-01p		ARS	李	耐受洋李痘疱病毒 (Plum Pox Virus Resistant)	C5
04-229-01p		孟山都 (Monsanto)	玉米	高赖氨酸(High Lysine)	LY038
04-125-01p		孟山都 (Monsanto)	玉米	耐受玉米食根昆虫 (Corn Rootworm Resistant)	88017
04-086-01p		孟山都 (Monsanto)	棉花	耐受草甘膦	MON 88913
03-353-01p		陶氏(Dow)	玉米	耐受玉米食根昆虫	59122
03-323-01p		孟山都 (Monsanto)	糖用甜菜	耐受草甘膦	H7-1

[0262]

03-181-01p	00-136-01p	陶氏(Dow)	玉米	耐受鳞翅类 & 耐受草胺磷	TC-6275
03-155-01p		先正达(Syngenta)	棉花	耐受鳞翅类	COT 102
03-036-01p		根公司/陶氏(Mycogen/Dow)	棉花	耐受鳞翅类	281-24-236
03-036-02p		根公司/陶氏(Mycogen/Dow)	棉花	耐受鳞翅类	3006-210-23
02-042-01p		安万特(Aventis)	棉花	耐受草胺磷(Phosphinothricin tolerant)	LL 棉花 25
01-324-01p	98-216-01p	孟山都(Monsanto)	油菜籽	耐受草甘膦	RT200
01-206-01p	98-278-01p	安万特(Aventis)	油菜籽	耐受草胺磷和授粉控制(Phosphinothricin & pollination control)	MS1 & RF1/RF2
01-206-02p	97-205-01p	安万特(Aventis)	油菜籽	耐受草胺磷	Topas 19/2
01-137-01p		孟山都(Monsanto)	玉米	耐受玉米食根昆虫	MON 863
01-121-01p		维克特(Vector)	烟草	减少烟碱(Reduced nicotine)	Vector 21-41
00-342-01p		孟山都(Monsanto)	棉花	耐受鳞翅类	棉花事件(Cotton Event) 15985
00-136-01p		根公司/陶氏&先锋(Mycogen c/o Dow & Pioneer)	玉米	耐受鳞翅类 耐受草胺磷	系 1507
00-011-01p	97-099-01p	孟山都(Monsanto)	玉米	耐受草甘膦	NK603
99-173-01p	97-204-01p	孟山都(Monsanto)	马铃薯	耐受 PLRV & CPB	RBMT22-82
98-349-01p	95-228-01p	艾格福(AgrEvo)	玉米	耐受草胺磷和雄性不育(Phosphinothricin tolerant and Male sterile)	MS6
98-335-01p		萨省大学(U. of Saskatchewan)	亚麻	耐受磺酰基脲除草剂的土壤残余物(Tolerant to soil residues of sulfonyl urea herbicide)	CDC Triffid
98-329-01p		艾格福(AgrEvo)	稻	耐受草胺磷	LLRICE06, LLRICE62
98-278-01p		艾格福(AgrEvo)	油菜籽	耐受草胺磷 & 授粉控制	MS8 & RF3

[0263]

98-238-01p		艾格福 (AgrEvo)	大豆	耐受草胺磷	GU262
98-216-01p		孟山都 (Monsanto)	油菜籽	耐受草甘膦	RT73
98-173-01p		诺维特斯种子 & 孟山都 (Novartis Seeds & Monsanto)	甜菜	耐受草甘膦	GTSB77
98-014-01p	96-068-01p	艾格福 (AgrEvo)	大豆	耐受草胺磷	A5547-127
97-342-01p		先锋(Pioneer)	玉米	雄性不育和耐受草胺磷(Male sterile & Phosphinothricin tolerant)	676, 678, 680
97-339-01p		孟山都 (Monsanto)	马铃薯	耐受 CPB & PVY (CPB & PVY resistant)	RBMT15-101, SEMT15-02, SEMT15-15
97-336-01p		艾格福 (AgrEvo)	甜菜	耐受草胺磷	T-120-7
97-287-01p		孟山都 (Monsanto)	番茄	耐受鳞翅类	5345
97-265-01p		艾格福 (AgrEvo)	玉米	耐受草胺磷 & 耐受 Lep.	CBH-351
97-205-01p		艾格福 (AgrEvo)	油菜籽	耐受草胺磷	T45
97-204-01p		孟山都 (Monsanto)	马铃薯	耐受 CPB & PLRV (CPB & PLRV resistant)	RBMT21-129 & RBMT21-350
97-148-01p		贝乔(Bejo)	菊苣属 (Cichorium intybus)	雄性不育	RM3-3, RM3-4, RM3-6
97-099-01p		孟山都 (Monsanto)	玉米	耐受草甘膦	GA21
97-013-01p		卡尔金 (Calgene)	棉花	耐受溴草腈 (Bromoxynil tolerant) & 耐受鳞翅类	事件 31807 & 31808
97-008-01p		杜邦(Du Pont)	大豆	改变油分布(Oil profile altered)	G94-1, G94-19, G-168
96-317-01p		孟山都 (Monsanto)	玉米	耐受草甘膦 & 耐受 ECB	MON802
96-291-01p		迪卡(DeKalb)	玉米	耐受欧洲玉米螟	DBT418
96-248-01p	92-196-01p	卡尔金 (Calgene)	番茄	改变果实催熟(Fruit ripening altered)	1 额外 (additional) FLAVRSAVR 系

[0264]

96-068-01p		艾格福 (AgrEvo)	大豆	耐受草胺磷	W62, W98, A2704-12, A2704-21, A5547-35
96-051-01p		康奈尔大学 (Cornell U)	木瓜	耐受 PRSV	55-1, 63-1
96-017-01p	95-093-01p	孟山都 (Monsanto)	玉米	耐受欧洲玉米螟	MON809 & MON810
95-352-01p		艾斯格瑞 (Asgrow)	南瓜	耐受 CMV, ZYMV, WMV2	CZW-3
95-338-01p		孟山都 (Monsanto)	马铃薯	耐受 CPB	SBT02-5 & -7, ATBT04-6 & -27, -30, -31, -36
95-324-01p		安格瑞托普 (Agritope)	番茄	改变果实催熟	35 1 N
95-256-01p		杜邦 (Du Pont)	棉花	耐受磷酰脲	19-51a
95-228-01p		植物基因系统 (Plant Genetic Systems)	玉米	雄性不育	MS3
95-195-01p		NK 种子公司 (Northrup King)	玉米	耐受欧洲玉米螟	Bt11
95-179-01p	92-196-01p	卡尔金 (Calgene)	番茄	改变果实催熟	2 额外 FLAVRSAVR 系
95-145-01p		迪卡 (DeKalb)	玉米	耐受草胺磷	B16
95-093-01p		孟山都 (Monsanto)	玉米	耐受鳞翅类	MON 80100
95-053-01p		孟山都 (Monsanto)	番茄	改变果实催熟	8338
95-045-01p		孟山都 (Monsanto)	棉花	耐受草甘膦	1445, 1698
95-030-01p	92-196-01p	卡尔金 (Calgene)	番茄	改变果实催熟	20 额外 FLAVRSAVR 系
94-357-01p		艾格福 (AgrEvo)	玉米	耐受草胺磷	T14, T25
94-319-01p		汽巴种子 (Ciba Seeds)	玉米	耐受鳞翅类	事件 176
94-308-01p		孟山都 (Monsanto)	棉花	耐受鳞翅类	531, 757, 1076
94-290-01p		ZP 公司 (Zeneca & Petoseed)	番茄	果实多聚半乳糖醛酸酶水平降低 (Fruit polygalacturonase level decreased)	B, Da, F
94-257-01p		孟山都 (Monsanto)	马铃薯	耐受甲虫类 (Coleopteran resistant)	BT6, BT10, BT12, BT16, BT17, BT18, BT23

[0265]

94-230-01p	92-196-01p	卡尔金 (Calgene)	番茄	改变果实催熟	9 额外 FLAVRSAVR 系
94-228-01p		DNA 植物技术 (DNA Plant Tech)	番茄	改变果实催熟	1345-4
94-227-01p	92-196-01p	卡尔金 (Calgene)	番茄	改变果实催熟	Line N73 1436-111
94-090-01p		卡尔金 (Calgene)	油菜籽	改变油分布	pCGN3828-212/8 6- 18 & 23
93-258-01p		孟山都 (Monsanto)	大豆	耐受草甘膦	40-3-2
93-196-01p		卡尔金 (Calgene)	棉花	耐受溴草腈	BXN
92-204-01p		优皮 (Upjohn)	南瓜	耐受 WMV2 & ZYMV	ZW-20
92-196-01p		卡尔金 (Calgene)	番茄	改变果实催熟	FLAVR SAVR

*** 请求号延伸：根据 7CFR 340.6(e)，可以请求 APHIS 将非管制身份的决定延伸到其它生物体，具体是基于该生物体与之前非管制项目的相似性。该栏列出了之前准予的非管制项目的请求号。

**** 初步 EA：在结束之前首先征询公众意见的环境评价。

[0266] 表C

[0267]

植物种	事件	特性	专利参考文献
玉米	PV-ZMGT32 (NK603)	耐受草甘膦	US 2007-056056
玉米	MIR604	抗虫性(Cry3a055)	EP 1 737 290
玉米	LY038	高赖氨酸含量	US 7,157,281
玉米	3272	自加工玉米 (α -淀粉酶)	US 2006-230473
玉米	PV-ZMIR13 (MON863)	抗虫性(Cry3Bb)	US 2006-095986
玉米	DAS-59122-7	抗虫性 (Cry34Ab1/Cry35Ab1)	US 2006-070139
玉米	TC1507	抗虫性(CryIF)	US 7,435,807
玉米	MON810	抗虫性(Cry1Ab)	US 2004-180373
玉米	VIP1034	抗虫性	WO 03/052073
玉米	B16	耐受草铵膦	US 2003-126634
玉米	GA21	耐受草甘膦	US 6,040,497
玉米	GG25	耐受草甘膦	US 6,040,497
玉米	GJ11	耐受草甘膦	US 6,040,497
玉米	FI117	耐受草甘膦	US 6,040,497
玉米	GAT-ZM1	耐受草铵膦	WO 01/51654
玉米	MON87460	耐旱	WO 2009/111263
玉米	DP-098140-6	耐受草甘膦/耐受 ALS 抑制剂	WO 2008/112019
小麦	事件 1	耐受镰孢菌属(单端孢霉烯 3-O-乙酰转移酶)	CA 2561992
糖用甜菜	T227-1	耐受草甘膦	US 2004-117870
糖用甜菜	H7-1	耐受草甘膦	WO 2004-074492
大豆	MON89788	耐受草甘膦	US 2006-282915

[0268]

大豆	A2704-12	耐受草铵膦	WO 2006/108674
大豆	A5547-35	耐受草铵膦	WO 2006/108675
大豆	DP-305423-1	高油酸/耐受 ALS 抑制剂	WO 2008/054747
稻	GAT-OS2	耐受草铵膦	WO 01/83818
稻	GAT-OS3	耐受草铵膦	US 2008-289060
稻	PE-7	抗虫性(Cry1Ac)	WO 2008/114282
油籽油菜	MS-B2	雄性不育	WO 01/31042
油籽油菜	MS-BN1/RF-BN1	雄性不育/恢复	WO 01/41558
油籽油菜	RT73	耐受草甘膦	WO 02/36831
棉花	CE43-67B	抗虫性(Cry1Ab)	WO 2006/128573
棉花	CE46-02A	抗虫性(Cry1Ab)	WO 2006/128572
棉花	CE44-69D	抗虫性(Cry1Ab)	WO 2006/128571
棉花	1143-14A	抗虫性(Cry1Ab)	WO 2006/128569
棉花	1143-51B	抗虫性(Cry1Ab)	WO 2006/128570
棉花	T342-142	抗虫性(Cry1Ab)	WO 2006/128568
棉花	事件 3006-210-23	抗虫性(Cry1Ac)	WO 2005/103266
棉花	PV-GHGT07 (1445)	耐受草甘膦	US 2004-148666
棉花	MON88913	耐受草甘膦	WO 2004/072235
棉花	EE-GH3	耐受草甘膦	WO 2007/017186
棉花	T304-40	抗虫性(Cry1Ab)	WO2008/122406
棉花	Cot202	抗虫性(VIP3)	US 2007-067868
棉花	LL 棉花 25	耐受草铵膦	WO 2007/017186
棉花	EE-GH5	抗虫性(Cry1Ab)	WO 2008/122406
棉花	事件 281-24-236	抗虫性(Cry1F)	WO 2005/103266
棉花	Cot102	抗虫性(Vip3A)	US 2006-130175
棉花	MON 15985	抗虫性(Cry1A/Cry2Ab)	US 2004-250317
常绿草(Bent Grass)	Asr-368	耐受草甘膦	US 2006-162007
矮瓜(Brinjal)	EE-1	抗虫性(Cry1Ac)	WO 2007/091277

[0269] 在通过本发明方法可控制的植物或作物的疾病中,可提及:

[0270] 白粉病,例如:

[0271] 白粉病(*Blumeria* diseases),由例如小麦白粉菌(*Blumeria graminis*)引起;

[0272] 叉丝单囊壳属病(*Podosphaera* diseases),由例如白叉丝单囊壳(*Podosphaera leuco-tricha*)引起;

[0273] 单丝壳属病(*Sphaerotheca* diseases),由例如苍耳单丝壳(*Sphaerotheca fuliginea*)引起的;

[0274] 钩丝壳属病(*Uncinula* diseases),例如由葡萄钩丝壳(*Uncinula necator*)引起;

[0275] 锈病,例如:

[0276] 胶锈菌属病(*Gymnosporangium* diseases),由例如赛宾锈菌(*Gymnosporangium sabinae*)引起;

[0277] 驼孢锈病(*Hemileia* diseases),由例如咖啡驼孢锈菌(*Hemileia vastatrix*)引起;

[0278] 层锈菌属病(*Phakopsora* diseases),由例如豆薯层锈菌(*Phakopsora pachyrhizi*)和山马蝗层锈菌(*Phakopsora meibomia*)引起;

- [0279] 柄锈菌属病(*Puccinia* diseases),例如由隐匿柄锈菌(*Puccinia recondite*)、禾柄锈菌(*Puccinia graminis*)或条形柄锈菌(*Puccinia striiformis*)引起;
- [0280] 单胞锈菌属病(*Uromyces* diseases),由例如疣顶单胞锈菌(*Uromyces appendiculatus*)引起;
- [0281] 卵菌病(*Oomycete* diseases),例如:
- [0282] 白锈病(*Albugo* diseases),由例如白锈菌(*Albugo candida*)引起的;
- [0283] 盘梗霉属病(*Bremia* diseases),由例如苣荬盘梗霉(*Bremia lactucae*)引起;
- [0284] 霜霉属病(*Peronospora* diseases),由例如豌豆霜霉(*Peronospora pisi*)和芸苔霜霉(*P.brassicae*)引起;
- [0285] 疫霉属病(*Phytophthora* diseases),由例如致病疫霉(*Phytophthora infestans*)引起;
- [0286] 单轴霉属病(*Plasmopara* diseases),由例如葡萄生单轴霉(*Plasmopara viticola*)引起;
- [0287] 假霜霉属病(*Pseudoperonospora* diseases),由例如葎草霜霉(*Pseudoperonospora humuli*)或黄瓜霜霉(*Pseudoperonospora cubensis*)引起的;
- [0288] 腐霉属病(*Pythium* diseases),由例如终极腐霉(*Pythium ultimum*)引起;
- [0289] 叶斑病、叶疱和叶枯病,例如:
- [0290] 支链孢属病(*Alternaria* diseases),例如由茄链格孢(*Alternaria solani*)引起;
- [0291] 尾孢霉属病(*Cercospora* diseases),由例如甜菜生尾孢(*Cercospora beticola*)引起;
- [0292] 金孢子菌属病(*Cladosporium* diseases),例如由瓜枝孢(*Cladosporium cucumerinum*)引起;
- [0293] 旋孢腔菌病(*Cochliobolus* diseases),例如由禾旋孢腔菌(*Cochliobolus sativus*(*Conidiaform:Drechslera*,*Syn:Helminthosporium*))或宫部旋孢腔菌(*Cochliobolus miyabeanus*)引起;
- [0294] 刺盘孢属病(*Colletotrichum* diseases),由例如豆刺盘孢(*Colletotrichum lindemuthianum*)引起;
- [0295] 油橄榄孔雀斑病(*Cycloconium*)病,由例如油橄榄孔雀斑菌(*Cycloconium oleaginum*)引起;
- [0296] 腐皮壳菌层病(*Diaporthe* diseases),由例如柑桔间座壳(*Diaporthe citri*)引起;
- [0297] 痂囊腔菌属病(*Elsinoe* diseases),由例如柑桔痂囊腔菌(*Elsinoe fawcettii*)引起;
- [0298] 长孢属病(*Gloeosporium* diseases),由例如悦色盘长孢(*Gloeosporium laeticolor*)引起;
- [0299] 小丛壳属病(*Glomerella* diseases),由例如围小丛壳(*Glomerella cingulata*)引起;
- [0300] 球座菌属病(*Guignardia* diseases),由例如葡萄球座菌(*Guignardia*

bidwellii)引起;

[0301] 小球腔菌属病(*Leptosphaeria diseases*),由例如十字花科小球腔菌(*Leptosphaeria maculans*)、颖枯小球腔菌(*Leptosphaeria nodorum*)引起;

[0302] 稻瘟病(*Magnaporthe diseases*),由例如稻瘟菌(*Magnaporthe grisea*)引起;

[0303] 球腔菌属病(*Mycosphaerella diseases*),由例如禾生球腔菌(*Mycosphaerella graminicola*)、落花生球腔菌(*Mycosphaerella arachidicola*)、香蕉黑条叶斑菌(*Mycosphaerella fijiensis*)引起的;

[0304] 壳针孢属病(*Phaeosphaeria diseases*),由例如颖枯壳针孢(*Phaeosphaeria nodorum*)引起;

[0305] 核腔菌属病(*Pyrenophora diseases*),例如由圆核腔菌(*Pyrenophora teres*)或偃麦草核腔菌(*Pyrenophora tritici repentis*)引起;

[0306] 柱隔孢属病(*Ramularia diseases*),由例如辛加柱隔孢(*Ramularia collo-cygni*)或白斑柱隔孢(*Ramularia areola*)引起;

[0307] 喙孢属病(*Rhynchosporium diseases*),由例如黑麦喙孢(*Rhynchosporium secalis*)引起;

[0308] 壳针孢属病(*Septoria diseases*),由例如芹菜小壳针孢(*Septoria apii*)或番茄壳针孢(*Septoria lycopersici*)引起;

[0309] 核瑚菌病(*Typhula diseases*),由例如肉色核瑚菌(*Typhula incarnata*)引起;

[0310] 黑星菌属病(*Venturia diseases*),例如由苹果黑星菌(*Venturia inaequalis*)引起;

[0311] 根病、鞘病和茎病,例如:

[0312] 伏革菌病(*Corticium diseases*),由例如禾伏革菌(*Corticium graminearum*)引起;

[0313] 镰孢菌(霉)属病(*Fusarium diseases*),由例如尖镰孢(*Fusarium oxysporum*)引起;

[0314] *Gaeumannomyces diseases*,caused for example by *Gaeumannomyces graminis*;

[0315] 丝核菌属病(*Rhizoctonia diseases*),由例如立枯丝核菌(*Rhizoctonia solani*)引起;

[0316] 水稻叶鞘腐败病(*Sarocladium diseases*),例如由稻帚枝霉(*Sarocladium oryzae*)引起;

[0317] 小核菌病(*Sclerotium diseases*),由例如稻腐小核菌(*Sclerotium oryzae*)引起;

[0318] 塔普斯(*Tapesia diseases*),由例如塔普斯梭状芽胞杆菌(*Tapesia acuformis*)引起;

[0319] 根串珠霉属病(*Thielaviopsis diseases*),由例如根串珠霉(*Thielaviopsis basicola*)引起;

[0320] 耳穗和圆锥花序病,例如:

[0321] 链格孢属病(*Alternaria diseases*),由例如链格孢(*Alternaria spp.*)引起;;

- [0322] 曲霉病(*Aspergillus* diseases),由例如黄曲霉(*Aspergillus flavus*)引起;
- [0323] 枝孢病(*Cladosporium* diseases),由例如枝孢(*Cladosporium* spp.)引起;;
- [0324] 麦角菌属病(*Claviceps* diseases),由例如麦角菌(*Claviceps purpurea*)引起;
- [0325] 镰孢菌(霉)属病(*Fusarium* diseases),由例如大刀镰孢(*Fusarium culmorum*)引起;
- [0326] 赤霉病(*Gibberella* diseases),由例如玉蜀黍赤霉(*Gibberella zeae*)引起;
- [0327] 水稻云形病(*Monographella* diseases),由例如水稻云形菌(*Monographella nivalis*)引起;
- [0328] 黑穗病和腥黑穗病,例如:
- [0329] 轴黑粉菌属病(*Sphacelotheca* diseases),由例如丝轴黑粉菌(*Sphacelotheca reiliana*)引起;
- [0330] 腥黑粉菌属病(*Tilletia* diseases),由例如小麦网腥黑粉菌(*Tilletia caries*)引起;
- [0331] 条黑粉菌属病(*Urocystis* diseases),由例如隐条黑粉菌(*Urocystis occulta*)引起;
- [0332] 黑粉菌属病(*Ustilago* diseases),由例如裸黑粉菌(*Ustilago nuda*)引起;
- [0333] 果实腐烂和霉菌病,例如:
- [0334] 曲霉病(*Aspergillus* diseases),由例如黄曲霉(*Aspergillus flavus*)引起;
- [0335] 葡萄孢菌属病(*Botrytis* diseases),由例如葡萄孢菌(*Botrytis cinerea*)引起的;
- [0336] 青霉病(*Penicillium* diseases),由例如甘薯青霉(*Penicillium expansum*)引起;
- [0337] 根霉病(*Rhizopus*),由例如匍枝根霉(*Rhizopus stolonifer*)引起;
- [0338] 核盘菌属病(*Sclerotinia* diseases),由例如核盘菌(*Sclerotinia sclerotiorum*)引起;
- [0339] 轮枝孢属病(*Verticillium* diseases),由例如黑白轮枝孢(*Verticillium albo-atrum*)引起;
- [0340] 种子和土壤中的腐烂、发霉、枯萎、腐败以及猝倒病:
- [0341] 链格孢病(*Alternaria* diseases),由例如芥链格孢(*Alternaria brassicicola*)
- [0342] 引起;
- [0343] 丝囊霉属病(*Aphanomyces* diseases),由例如豌豆丝囊霉(*Aphanomyces euteiches*)引起;
- [0344] 壳二孢属病(*Ascochyta* diseases),由例如晶状体二孢菌(*Ascochyta lentis*)引起;
- [0345] 曲霉病(*Aspergillus* diseases),由例如黄曲霉(*Aspergillus flavus*)引起;
- [0346] 枝孢病(*Cladosporium* diseases),由例如多主枝孢(*Cladosporium herbarum*)引起;
- [0347] 旋孢腔菌病(*Cochliobolus* diseases),例如由禾旋孢腔菌(*Cochliobolus sativus*)(*Conidiaform:Drechslera*,*Bipolaris* Syn:*Helminthosporium*)引起;

- [0348] 刺盘孢病(*Colletotrichum* diseases),由例如粒状体刺盘孢(*Colletotrichum coccodes*)引起;
- [0349] 镰孢菌(霉)属病(*Fusarium* diseases),由例如大刀镰孢(*Fusarium culmorum*)引起;
- [0350] 赤霉病(*Gibberella* diseases),由例如玉蜀黍赤霉(*Gibberella zeae*)引起;
- [0351] 壳球孢病(*Macrophomina* diseases),由例如豆类壳球孢(*Macrophomina phaseolina*)引起;
- [0352] 水稻云形病(*Monographella* diseases),由例如水稻云形菌(*Monographella nivalis*)引起;
- [0353] 青霉病(*Penicillium* diseases),由例如甘薯青霉(*Penicillium expansum*)引起;
- [0354] 茎点霉病(*Phoma* diseases),由例如黑胫茎点霉(*Phoma lingam*)引起;
- [0355] 茎点霉病(*Phomopsis* diseases),由例如大豆茎点霉(*Phomopsis sojae*)引起;
- [0356] 疫霉属病(*Phytophthora* diseases),由例如恶疫霉(*Phytophthora cactorum*)引起;
- [0357] 核腔菌病(*Pyrenophora* diseases),由例如麦类核腔菌(*Pyrenophora graminea*)引起;
- [0358] 梨孢属病(*Pyricularia* diseases),由例如稻梨孢(*Pyricularia oryzae*)引起的;
- [0359] 腐霉属病(*Pythium* diseases),由例如终极腐霉(*Pythium ultimum*)引起;
- [0360] 丝核菌属病(*Rhizoctonia* diseases),由例如立枯丝核菌(*Rhizoctonia solani*)引起;
- [0361] 根霉病(*Rhizopus* diseases),由例如米根霉(*Rhizopus oryzae*)引起;
- [0362] 小核菌病(*Sclerotium* diseases),由例如齐整小核菌(*Sclerotium rolfsii*)引起的;
- [0363] 壳针孢病(*Septoria* diseases),例如由颖枯壳针孢(*Septoria nodorum*)引起;
- [0364] 核瑚菌病(*Typhula* diseases),由例如肉色核瑚菌(*Typhula incarnata*)引起;
- [0365] 轮枝孢病(*Verticillium* diseases),由例如大丽花轮枝孢(*Verticillium dahliae*)引起;
- [0366] 溃疡、开裂及梢枯病,例如:
- [0367] 丛赤壳属病(*Nectria* diseases),由例如干癌丛赤壳菌(*Nectria galligena*)引起;
- [0368] 枯萎病,例如:
- [0369] 链核盘菌属病(*Monilinia* diseases),由例如核果链核盘菌(*Monilinia laxa*)引起;
- [0370] 叶泡或卷叶病,例如:
- [0371] 外担子菌病(*Exobasidium* diseases),由例如损坏外担子菌(*Exobasidium vexans*)引起;
- [0372] 外囊菌属病(*Taphrina* diseases),由例如畸形外囊菌(*Taphrina deformans*)引

起;

[0373] 木植物衰退病,例如:

[0374] 依科病(*Esca diseases*),由例如根霉格孢菌(*Phaeomoniella clamydospora*)引起;

[0375] 葡萄顶枯病(*Eutypa dieback*),由例如葡萄藤猝倒病菌(*Eutypa lata*)引起;

[0376] 灵芝病(*Ganoderma diseases*),由例如岛灵芝(*Ganoderma boninense*)引起;

[0377] 硬孔菌属病(*Rigidoporus diseases*),由例如木硬孔菌(*Rigidoporus lignosus*)引起;

[0378] 花和种子的疾病,例如:

[0379] 葡萄孢属病(*Botrytis diseases*),由例如灰葡萄孢(*Botrytis cinerea*)引起;

[0380] 根茎类疾病,例如:

[0381] 丝核菌属病(*Rhizoctonia diseases*),由例如立枯丝核菌(*Rhizoctonia solani*)引起;

[0382] 长蠕孢菌属病(*Helminthosporium diseases*),由例如立枯长蠕孢(*Helminthosporium solani*)引起;

[0383] 根肿病,例如:

[0384] 根肿菌病(*Plasmodiophora diseases*),由例如芸苔根肿菌(*Plasmodiophora brassicae*)引起;

[0385] 由细菌生物体引起的病,例如:

[0386] 黄单胞菌属物种,由例如野油菜黄单胞菌水稻致病变种(*Xanthomonas campestris* pv.*oryzae*)引起;

[0387] 假单胞菌属物种(*Pseudomonas species*),由例如丁香假单胞菌黄瓜致病变种(*Pseudomonas syringae* pv.*lachrymans*)引起;

[0388] 欧文氏菌属物种(*Erwinia species*),例如由解淀粉欧文氏菌(*Erwinia amylovora*)引起。

[0389] 本发明的组合物还可用于治疗易于在木材上或木材内部生长的真菌疾病。术语“木材”是指所有类型的木材、以及对该木材进行加工用于建筑业的所有类型的加工材料,例如实木、高密度木材、层压木材和胶合板。本发明处理木材的方法主要在于接触一种或多种本发明化合物或本发明组合物;这包括例如直接施用、喷涂、浸渍、注射或任意其它适合的方法。

[0390] 在根据本发明的处理方法中,对于应用于叶处理时,活性化合物通常施用剂量优选为10-800克/公顷,更好为50-300克/公顷。对于种子处理,活性物质的施用剂量通常优选为2-200克/100千克种子,更好为3-150克/100千克种子。

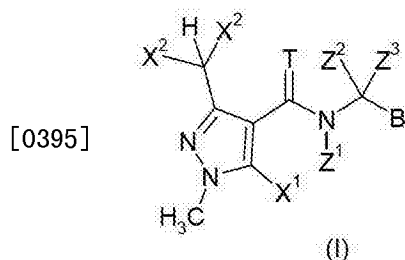
[0391] 应该清楚地理解,上述剂量是作为本发明方法的说明性例子给出。本领域技术人员知道如何根据待处理植物或农作物的性质调节施用剂量。

[0392] 本发明的化合物或混合物也可以用于制备对于治疗性或预防性治疗人或动物真菌疾病有用的组合物,这些疾病例如霉菌病(*mycose*)、皮肤病、发癣菌病和念珠菌病或由曲霉属(*Aspergillus spp.*)如烟曲霉(*Aspergillus fumigatus*)引起的疾病。

[0393] 下面将参考下表化合物实施例和以下制备或药效实施例对本发明的各方面进行

说明。

[0394] 表1显示本发明通式(I)的化合物的非限制性例子：



[0396] 在表1中, $M+H(ApcI+)$ 表示通过正气压化学电离在质谱中观察到的+1a.m.u.(原子质量单位)的分子离子峰。

[0397] 在表1中, 依据EEC Directive79/831Annex V.A8, 通过HPLC(高效液相色谱)使用以下方法在反相柱(C18)上测量logP值：

[0398] 温度:40°C;流动相:0.1%的甲酸水溶液和乙腈;线性梯度为10%乙腈到90%乙腈。

[0399] 使用logP值已知的非支链烷-2-酮(包含3-16个碳原子)进行校准(logP值是采用两个相邻烷酮之间的线性内插法由保留时间确定的)。使用200纳米至400纳米的紫外光谱, 在色谱信号最大值处确定 λ_{max} 值。

[0400] 表1：

[0401]

实施例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	质量 (M+H))
1	F	F	O	甲基	H	H	2-呋喃基	1.87	288
2	Cl	F	O	1-环丙基乙基	H	H	2-呋喃基	2.98	358
3	F	F	O	1-环丙基乙基	H	H	2-呋喃基	2.82	342
4	Cl	F	O	环丙基	H	H	2-呋喃基	2.45	330
5	F	F	O	环丙基	H	H	2-呋喃基	2.32	314
6	Cl	F	O	甲基	H	H	2-呋喃基	2.02	304
7	Cl	F	O	环己基	H	H	2-呋喃基	3.35	372
8	F	F	O	环己基	H	H	2-呋喃基	3.21	356
9	Cl	F	O	H	H	H	2-呋喃基	1.86	290
10	F	F	O	H	H	H	2-呋喃基	1.66	274
11	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		2-呋喃基	2.86	344
12	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		2-呋喃基	2.70	328

[0402]

实施例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	质量 (M+H))
13	Cl	F	O	2,2,2-三氟 乙基	H	H	吡啶-3-基	1.37	383
14	F	F	O	2,2,2-三氟 乙基	H	H	吡啶-3-基	1.20	367
15	Cl	F	O	环庚基	H	H	吡啶-3-基	1.76	397
16	F	F	O	环庚基	H	H	吡啶-3-基	1.66	381
17	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		吡啶-3-基	0.96	355
18	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		吡啶-3-基	0.84	339
19	Cl	F	O	甲基	i-Pr ⁽¹⁾	H	噻啶-5-基	1.76	358
20	F	F	O	甲基	i-Pr	H	噻啶-5-基	1.65	342
21	Cl	F	O	甲基	H	H	3-甲基-2-呋喃基	2.32	318
22	F	F	O	甲基	H	H	3-甲基-2-呋喃基	2.18	302
23	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		2-甲基-3-呋喃基	3.11	358
24	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		2-甲基-3-呋喃基	2.92	342
25	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		1-甲基- 1H-吡啶-3-基	1.93	358
26	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		1-甲基- 1H-吡啶-3-基	2.25	342
27	Cl	F	O	乙基	H	H	4-甲基- 1,2,5-噁二唑-3-基	2.20	334
28	F	F	O	乙基	H	H	4-甲基- 1,2,5-噁二唑-3-基	2.05	318
29	Cl	F	O	丙基	H	H	2-噻吩基	2.90	348
30	F	F	O	丙基	H	H	2-噻吩基	2.77	332
31	Cl	F	O	环丙基	H	H	2-噻吩基	2.73	346
32	F	F	O	环丙基	H	H	2-噻吩基	2.59	330

[0403]

实施 例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	质量 (M+H)
33	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		2-噻吩基	3.13	360
34	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		2-噻吩基	2.96	344
35	F	F	O	环丙基	Me ⁽¹⁾	H	2,5-二甲基-3-呋喃基	3.21	356
36	Cl	F	O	环丙基	Me	H	2,5-二甲基-3-呋喃基	3.37	372
37	Cl	F	O	环戊基	H	H	3-甲基-2-噻吩基	3.61	388
38	F	F	O	环戊基	H	H	3-甲基-2-噻吩基	3.46	372
39	Cl	F	O	环丙基	H	H	3-甲基-2-噻吩基	3.02	360
40	F	F	O	环丙基	H	H	3-甲基-2-噻吩基	2.88	344
41	Cl	F	O	甲基	H	H	3-甲基-2-噻吩基	2.58	334
42	F	F	O	甲基	H	H	3-甲基-2-噻吩基	2.44	318
43	Cl	F	O	烯丙基	H	H	2-甲基- 1,3-噻唑-4-基	2.20	361
44	F	F	O	烯丙基	H	H	2-甲基- 1,3-噻唑-4-基	2.07	345
45	F	F	O	乙基	H	H	1-乙基-3-甲基- 1H-吡唑-4-基	1.69	344
46	Cl	F	O	乙基	H	H	1-乙基-3-甲基- 1H-吡唑-4-基	1.79	360
47	F	F	O	H	H	H	1-乙基-3-甲基- 1H-吡唑-4-基	1.31	316
48	F	F	O	环丙基	Me	H	2,5-二甲基-3-噻吩基	3.62	372
49	Cl	F	O	环丙基	Me	H	2,5-二甲基-3-噻吩基	3.79	388
50	F	F	O	环丙基	Me	H	2-氯吡啶-3-基	2.23	373
51	Cl	F	O	甲基	H	H	2-氯吡啶-3-基	1.87	349
52	F	F	O	甲基	H	H	2-氯吡啶-3-基	1.72	333

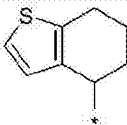
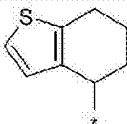
[0404]

实施 例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	质量 (M+H)
53	Cl	F	O	甲基	H	H	2-氯吡啶-4-基	1.91	349
54	F	F	O	甲基	H	H	2-氯吡啶-4-基	1.76	333
55	Cl	F	O	甲基	H	H	5-氯吡啶-3-基	1.90	349
56	F	F	O	甲基	H	H	5-氯吡啶-3-基	1.76	333
57	F	F	O	环戊基	H	H	6-氯吡啶-3-基	2.80	387
58	Cl	F	O	2-甲氧基 乙基	H	H	6-氯吡啶-3-基	2.15	393
59	F	F	O	2-甲氧基 乙基	H	H	6-氯吡啶-3-基	2.02	377
60	Cl	F	O	乙基	H	H	6-氯吡啶-3-基	2.23	363
61	F	F	O	乙基	H	H	6-氯吡啶-3-基	2.10	347
62	Cl	F	O	甲基	H	H	6-氯吡啶-3-基	1.98	349
63	F	F	O	甲基	H	H	6-氯吡啶-3-基	1.84	333
64	Cl	F	O	异丙基	H	H	6-氯吡啶-3-基	2.49	377
65	F	F	O	异丙基	H	H	6-氯吡啶-3-基	2.33	361
66	Cl	F	O	环丙基	H	H	6-氯吡啶-3-基	2.39	375
67	F	F	O	环丙基	H	H	6-氯吡啶-3-基	2.25	359
68	Cl	F	O	环戊基	H	H	6-氯吡啶-3-基	2.94	403
69	Cl	F	O	H	H	H	6-氯吡啶-3-基	1.82	335
70	F	F	O	环丙基	Me	H	1-苯并呋喃-2-基	3.42	378
71	F	F	O	环丙基	H	H	1-苯并呋喃-2-基	3.11	364
72	Cl	F	O	环丙基	H	H	1-苯并呋喃-2-基	3.21	380

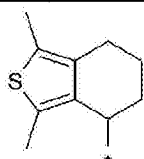
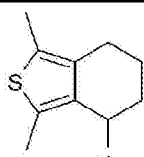
[0405]

实施 例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	质量 (M+H)
73	F	F	S	环丙基	H	H	1-苯并呋喃-2-基	3.76	380
74	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		1-苯并呋喃-2-基	3.70	394
75	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		1-苯并呋喃-2-基	3.52	378
76	F	F	O	乙基	H	H	2-氯- 1,3-噻唑-5-基	2.21	353
77	Cl	F	O	乙基	H	H	2-氯- 1,3-噻唑-5-基	2.35	369
78	Cl	F	O	乙基	H	H	1-乙基-3,5-二甲基 -1H-吡唑-4-基	1.82	374
79	F	F	O	乙基	H	H	1-乙基-3,5-二甲基 -1H-吡唑-4-基	1.72	358
80	F	F	O	环丙基	Me	H	1-苯并噻吩-2-基	3.69	394
81	Cl	F	O	H	Me	H	1-苯并噻吩-2-基	3.13	370
82	F	F	O	H	Me	H	1-苯并噻吩-2-基	2.98	354
83	Cl	F	O	H	H	H	1-苯并噻吩-2-基	2.92	356
84	F	F	O	H	H	H	1-苯并噻吩-2-基	2.75	340
85	F	F	O	环丙基	Me	H	1-苯并噻吩-3-基	3.60	394
86	F	F	S	环丙基	Me	H	1-苯并噻吩-3-基	4.44	410
87	Cl	F	O	H	H	H	1-苯并噻吩-3-基	2.90	356
88	F	F	O	H	H	H	1-苯并噻吩-3-基	2.73	340
89	Cl	F	O	环丙基	H	H	1-苯并噻吩-3-基	3.41	396
90	F	F	O	环丙基	H	H	1-苯并噻吩-3-基	3.27	380
91	F	F	O	环丙基	Me	H	1-苯并噻吩-7-基	3.44	394
92	Cl	F	O	环丙基	Me	H	1-苯并噻吩-7-基	3.61	410

[0406]

实 施 例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	质量 (M+H)
93	F	F	O	环丙基	H	H	1-苯并噻吩-7-基	3.19	380
94	Cl	F	O	环丙基	H	H	1-苯并噻吩-7-基	3.31	396
95	F	F	S	环丙基	H	H	1-苯并噻吩-7-基	3.83	396
96	F	F	S	环丙基	H	H	1-苯并噻吩-7-基	4.16	410
97	Cl	F	O	环丙基	H	H	1,3-苯并噻唑-2-基	2.80	397
98	F	F	O	环丙基	H	H	1,3-苯并噻唑-2-基	2.68	381
99	Cl	F	O	甲基	H	H	2,1,3-苯并噻唑-5-基	2.32	372
100	F	F	O	甲基	H	H	2,1,3-苯并噻唑-5-基	2.17	356
101	Cl	F	O	甲基	H	H	6-异丙氧基 吡啶-3-基	2.59	373
102	F	F	O	甲基	H	H	6-异丙氧基 吡啶-3-基	2.45	357
103	Cl	F	O	H				2.90	346
104	F	F	O	H				2.73	330
105	F	F	O	甲基	H	H	3-(2,2-二甲基丙基)- 1,2-噻唑-5-基	2.75	359
106	F	F	O	环丙基	H	H	3-(2,2-二甲基丙基)- 1,2-噻唑-5-基	3.17	385
107	Cl	F	O	环丙基	H	H	3-(2,2-二甲基丙基)- 1,2-噻唑-5-基	3.31	401
108	Cl	F	O	甲基	H	H	1-苯基-1H- 吡啶-4-基	2.40	380
109	F	F	O	甲基	H	H	1-苯基-1H- 吡啶-4-基	2.26	364
110	F	F	O	甲基	H	H	3-苯基- 1,2-噻唑-5-基	2.51	365

[0407]

实施例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	质量 (M+H ⁺)
111	F	F	O	环丙基	H	H	3-苯基- 1,2-噁唑-5-基	2.92	391
112	Cl	F	O	环丙基	H	H	3-苯基- 1,2-噁唑-5-基	3.04	407
113	Cl	F	O	甲基	H	H	3-苯基- 1,2,4-噁二唑-5-基	2.71	382
114	F	F	O	甲基	H	H	3-苯基- 1,2,4-噁二唑-5-基	2.58	366
115	F	F	O	环丙基	H	H	3,5-二氯吡啶-4-基	2.54	393
116	Cl	F	O	环丙基	H	H	3,5-二氯吡啶-4-基	2.64	409
117	F	F	S	环丙基	H	H	3,5-二氯吡啶-4-基	3.29	409
118	F	F	O	环丙基	H	H	4,6-二氯吡啶-3-基	2.73	393
119	Cl	F	O	环丙基	H	H	4,6-二氯吡啶-3-基	2.90	409
120	Cl	F	O	环丙基	Me	H	5,6-二氯吡啶-3-基	3.27	423
121	F	F	O	环丙基	Me	H	5,6-二氯吡啶-3-基	3.11	407
122	F	F	O	环丙基	H	H	3-甲基-1-苯并噁吩 -2-基	3.64	394
123	Cl	F	O	环丙基	H	H	3-甲基-1-苯并噁吩 -2-基	3.74	410
124	F	F	S	环丙基	H	H	3-甲基-1-苯并噁吩 -2-基	4.31	410
125	F	F	O	H				3.39	358
126	Cl	F	O	H				3.57	374
127	Cl	F	O	环丙基	Me	H	2,5-二氯-3-噁吩基	4.24	428
128	F	F	O	环丙基	Me	H	2,5-二氯-3-噁吩基	4.03	412

[0408]

实施 例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	质量 (M+H)
129	Cl	F	O	甲基	H	H	5-甲基-3-苯基- 1,2-噁唑-4-基	2.59	395
130	F	F	O	甲基	H	H	5-甲基-3-苯基- 1,2-噁唑-4-基	2.44	379
131	F	F	O	环丙基	H	H	5-甲基-2-苯基- 2H-1,2,3-三唑-4-基	3.29	405
132	F	F	S	环丙基	H	H	5-甲基-2-苯基- 2H-1,2,3-三唑-4-基	4.04	421
133	F	F	O	甲基	H	H	4-溴-3-噻吩基	2.52	382
134	Cl	F	O	甲基	H	H	4-溴-3-噻吩基	2.70	398
135	F	F	O	环丙基	H	H	3-溴-2-噻吩基	3.11	408
136	Cl	F	O	环丙基	H	H	3-溴-2-噻吩基	3.29	424
137	F	F	O	环丙基	H	H	6-氯喹啉-4-基	2.44	409
138	F	F	O	环丙基	H	H	2-氯喹啉-4-基	2.92	409
139	Cl	F	O	环丙基	H	H	2-氯喹啉-4-基	3.09	425
140	F	F	O	环丙基	H	H	2-甲基-4-(三氟甲 基)- 1,3-噻唑-5-基	2.75	413
141	Cl	F	O	甲基	H	H	3-氯-1-苯并噁吩-2- 基	3.63	404
142	F	F	O	甲基	H	H	3-氯-1-苯并噁吩-2- 基	3.48	388
143	F	F	O	环丙基	H	H	5-氯-1-苯并噁吩-3- 基	3.73	414
144	Cl	F	O	环丙基	H	H	5-氯-1-苯并噁吩-3- 基	3.83	430
145	F	F	S	环丙基	H	H	5-氯-1-苯并噁吩-3- 基	4.36	430
146	Cl	F	O	环丙基	H	H	2,5-二甲基-1-苯基- -1H-吡咯-3-基	3.94	433
147	F	F	O	环丙基	Me	H	2-甲基-5-苯基- 3-噻吩基	4.41	434
148	Cl	F	O	甲基	H	H	4-甲基-2-苯基- 1,3-噁唑-5-基	2.90	411

[0409]

实施例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	质量 (M+H))
149	F	F	O	甲基	H	H	4-甲基-2-苯基- 1,3-噻唑-5-基	2.77	395
150	F	F	O	异丙基	H	H	1-(4-氯苯基)- 1H-吡唑-4-基	3.25	426
151	Cl	F	O	异丙基	H	H	1-(4-氯苯基)- 1H-吡唑-4-基	3.39	442
152	F	F	O	甲基	H	H	3-(4-氯苯基)- 1,2-噻唑-5-基	3.04	399
153	F	F	O	环丙基	H	H	3-(4-氯苯基)- 1,2-噻唑-5-基	3.46	425
154	Cl	F	O	环丙基	H	H	3-(4-氯苯基)- 1,2-噻唑-5-基	3.59	441
155	F	F	O	环丙基	H	H	1-苯基-1H-咪唑-2- 基	3.96	439
156	Cl	F	O	环丙基	H	H	1-苯基-1H-咪唑-2- 基	4.13	455
157	F	F	O	甲基	i-Pr	H	2-(甲基硫烷基)- 4-(三氟甲基) 嘧啶-5-基	3.46	456
158	Cl	F	O	甲基	i-Pr	H	2-(甲基硫烷基)- 4-(三氟甲基) 嘧啶-5-基	3.59	472
159	F	F	O	环丙基	H	H	2-(三氟甲基) 喹啉-4-基	3.58	443
160	Cl	F	O	环丙基	H	H	2-(三氟甲基) 喹啉-4-基	3.72	459
161	F	F	S	环丙基	H	H	2-(三氟甲基) 喹啉-4-基	4.26	459
162	Cl	F	O	环丙基	H	H	5,7-二氯 喹啉-4-基	3.57	459
163	F	F	O	环丙基	H	H	5,7-二氯 喹啉-4-基	3.39	443
164	F	F	O	甲基	H	H	3-(3,4,5-三氟 苯基)-1,2-噻唑-5-基	3.11	419
165	F	F	O	环丙基	H	H	3-(3,4,5-三氟 苯基)-1,2-噻唑-5-基	3.53	445
166	Cl	F	O	环丙基	H	H	3-(3,4,5-三氟 苯基)-1,2-噻唑-5-基	3.64	461
167	F	F	O	环丙基	H	H	2-(4-氯苯基)-4-甲基 -1,3-噻唑-5-基	3.85	455

[0410]

实施例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	质量 (M+H))
168	Cl	F	O	环丙基	H	H	2-(4-氯苯基)-4-甲基-1,3-噻唑-5-基	4.01	471
169	F	F	O	环丙基	H	H	5-氯-3-异丙基-1-苯基-1H-吡唑-4-基	3.94	466
170	F	F	O	环丙基	H	H	5-(二氟甲氧基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-基	2.76	

[0411] 注⁽¹⁾:Me:甲基;i-Pr:异丙基

[0412] 以下实施例以非限制性的方式对依据本发明的通式(I)化合物的制备和药效予以说明。

[0413] 5-氯-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸的合成(实施例IIIa-1)

[0414] 在500毫升烧瓶中,向30毫升甲苯中添加6.0克(31毫摩尔)的5-氯-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醛(carbaldehyde)。将2.4克(62毫摩尔)氢氧化钠的6毫升水溶液加入反应混合物中,然后加入103毫升30%的过氧化氢水溶液,同时保持温度低于37℃。在加料结束后,将反应混合物在50℃搅拌7小时。在反应混合物回到室温后,立即分离两相,用100毫升水萃取有机相。用盐酸水溶液将合并的水相酸化到pH为2。过滤所得的白色沉淀物,用20毫升水洗涤两次,干燥,得到3.2克白色固体5-氯-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸。¹H NMR(400MHz,DMSO-d₆)δppm:3.78(s,3H);7.12(t,1H,JHF=53.60Hz);13.19(s,1H);IR(KBr):1688cm⁻¹(C=O);2200-3200cm⁻¹宽峰(氢键)。

[0415] 5-氯-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰氯的合成(实施例IIIb-1)

[0416] 将3.2克5-氯-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸和44.3毫升亚硫酰氯回流5小时。冷却后,将反应混合物在真空下蒸发,得到3.5克黄色油状5-氯-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰氯。¹H NMR(400MHz,CHCl₃-d₆)δppm:3.97(s,3H);7.00(t,J=52.01Hz,1H);IR(TQ):1759和1725cm⁻¹(C=O)。

[0417] 3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰氟的合成(实施例IIIc-1)

[0418] 在100℃,向4.0克(70毫摩尔)氟化钾的21毫升四氢噻吩-1,1-二氧化物无水溶液中加入5.0克(22毫摩尔)5-氯-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰氯的15毫升甲苯溶液。将所得的反应混合物在190-200℃搅拌22小时。在真空下蒸馏,得到8克(25%摩尔浓度(molar))的3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰氟的四氢-噻吩-1,1-二氧化物溶液。¹H NMR(250MHz,CHCl₃-d₆)δppm:3.87(s,3H);6.79(t,J=53.75Hz,1H);¹⁹F NMR(250MHz,CHCl₃-d₆)δppm:45.37(s,COF);-117.5(d,J=28.2Hz);-131.6(m)。

[0419] 3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸的合成(实施例IIId-1)

[0420] 向400毫升1N氢氧化钠水溶液中滴加67.5克(10%摩尔浓度)的3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰氟的四氢噻吩-1,1-二氧化物溶液。在加料过程中将温度保持低于20℃。在室温搅拌2小时后,用浓盐酸水溶液将反应混合物小心酸化到pH为2。过滤所得白色沉淀物,用水洗涤,干燥,得到6克白色固体3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧

酸。¹H NMR(400MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 3.90(s, 3H); 7.22(t, 1H, J_{HF}=53.55Hz); 13.33(s, 1H)。

[0421] 3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰氯的合成(实施例IIIe-1)

[0422] 将9.1克3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸和75.5毫升亚硫酰氯回流1.5小时。冷却后,将反应混合物在真空下蒸发,得到10克黄色油状3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰氯。GC-MS;观察的M/z:分子离子:(M⁺)=212;碎片:(M⁺-Cl)=177和(M⁺-F)=193。

[0423] 通用制备实施例2:在Chemspeed™设备上的通式(I)的酰胺的制备

[0424] 将4毫升0.15摩尔浓度(molar)胺(II)(0.60毫摩尔)的二氯甲烷溶液分配在13毫升Chemspeed™小瓶中,随后分配0.72毫摩的三乙胺。以1毫升/分钟的速率,添加2毫升0.3摩尔浓度酰氯溶液(IIIb)或(IIIe)(0.60毫摩尔),将该混合物在室温条件下搅拌过夜。再添加1毫升水,将混合物倒在碱性氧化铝筒(2克)上,并用二氯甲烷洗脱。除去溶剂,用LCMS和NMR对粗制的酰胺衍生物进行分析。纯度不够的化合物进一步用制备型LCMS进行纯化。

[0425] 通用制备实施例3:在Chemspeed™设备上的通式(I)的酰胺的硫羰化

[0426] 在一个13毫升的Chemspeed™小瓶中称量0.27毫摩尔的五硫化二磷(P₂S₅)。加入3毫升0.18M酰胺(I)(0.54毫摩尔)的二噁烷溶液,将该混合物回流加热2小时。然后,使温度冷却到80°C,加入2.5毫升水。将混合物在80°C再加热1小时。然后,加入2毫升水,用4毫升二氯甲烷萃取反应混合物2次。将有机相沉积在碱性氧化铝筒(2克)上,用8毫升二氯甲烷洗脱两次。除去溶剂,粗制的硫代酰胺衍生物用LCMS和NMR分析。纯度不够的化合物进一步用制备型LCMS进行纯化。

[0427] 实施例A:对苍耳单丝壳(Sphaerotheca fuliginea)(黄瓜)的体内预防性测试

[0428] 溶剂:49重量份的N,N-二甲基甲酰胺

[0429] 乳化剂:1重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

[0430] 为了获得活性化合物的合适制剂,将1重量份的活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂进行混合,并用水将浓缩物稀释至所需的浓度。

[0431] 为了测试预防活性,使用活性化合物的制剂在所述施用比率下对幼龄植物进行喷涂。在该处理1天后,用苍耳单丝壳(Sphaerotheca fuliginea)的孢子水性悬浮液对上述植物进行接种。然后将所述植物放在约23°C、相对大气湿度约70%的温室中。

[0432] 在接种7天后对测试进行评估。0%表示相当于未处理的对照样的药效,100%的药效表示没有观察到疾病。

[0433] 在这些条件下,使用下表A的化合物在活性成分剂量为500ppm的情况下观察到良好保护(至少70%)至完全保护:

[0434] 表A:

[0435]

实施例	药效	实施例	药效	实施例	药效
32	95	91	88	137	90
34	70	95	88	140	100
40	90	96	100	143	95
50	100	115	83	145	93
69	70	117	95	147	88
70	98	124	98	161	100
73	85	128	98	163	100
80	99	131	97	169	100
85	94	132	100	170	88

[0436] 在相同条件下,化合物69在活性成分剂量为500ppm的情况下观察到良好保护(至少70%),而专利申请CN-1188764中揭示的实施例186的化合物观察到无保护,如表A2所示。

[0437] 表A2:

[0438]

实施例	剂量(ppm)	药效
本发明的69	500	70
CN-1188764的186	500	0

[0439] 国际专利CN-1188764中揭示的实施例186相当于5-氯-N-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-羧酰胺。

[0440] 这些结果表明,依据本发明的各个化合物的生物活性比CN-1188764所揭示的结构上最接近的化合物好得多。

[0441] 实施例B:对茄链格孢(Alternaria solani)(番茄)的体内预防性测试

[0442] 溶剂:49重量份的N,N-二甲基甲酰胺

[0443] 乳化剂:1重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

[0444] 为了获得活性化合物的合适制剂,将1重量份的活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂进行混合,并用水将浓缩物稀释至所需的浓度。

[0445] 为了测试预防活性,使用活性化合物的制剂在所述施用比率下对幼龄植物进行喷涂。在该处理1天后,用茄链格孢(Alternaria solani)的孢子水性悬浮液对上述植物进行接种。将所述植物在约22°C、相对大气湿度为100%的温育箱中保持1天。然后将所述植物放置在约20°C、相对大气湿度为96%的温育箱中。

[0446] 在接种7天后对测试进行评估。0%表示相当于未处理的对照样的药效,100%的药效表示没有观察到疾病。

[0447] 在这些条件下,使用下表B的化合物在活性成分剂量为500ppm的情况下观察到良好的(至少70%)至完全的保护:

[0448] 表B:

[0449]

实施例	药效	实施例	药效	实施例	药效
5	80	90	95	124	100
10	100	91	95	125	94
28	90	93	100	127	95
32	70	94	95	128	100
37	80	95	95	131	90
39	95	96	95	132	90
40	95	98	80	133	70
42	70	100	95	137	80
48	95	103	94	138	95
49	80	104	94	140	80
50	95	105	95	142	80
67	95	106	95	143	95
70	100	108	90	145	90
71	95	109	95	147	95
73	90	111	95	149	80
75	70	114	95	153	90
81	100	115	100	155	95
82	100	116	90	157	70
83	94	117	100	165	100
85	80	118	95	167	90
86	70	120	90	169	100
88	78	121	95	170	95
89	80	122	95		

[0450] 在相同条件下,化合物138在活性成分剂量为500ppm的情况下观察到极好的保护(大于95%),而W0-2009/016221中要求保护的脱氟类似物化合物CMP1观察到无保护,如表B2所示。

[0451] 表B2:

实施例	剂量(ppm)	药效
本发明的138	500	95
WO-2009/016221的CMP1	500	0

[0453] W0-2008/016221中要求保护的脱氟类似物化合物CMP1相当于N-[(2-氯喹啉-4-基)甲基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺。

[0454] 这些结果表明,依据本发明的各个化合物的生物活性比W0-2008/016221所揭示的结构上最接近的化合物好得多。

[0455] 在相同条件下,化合物71在活性成分剂量为500ppm的情况下观察到极好保护(至少95%),而专利申请W0-2009/016222中揭示的实施例28的化合物观察到无保护,如表B3所示。

[0456] 表B3:

实施例	剂量(ppm)	药效
本发明的71	500	95
WO-2009/016222的28	500	0

[0458] 国际专利W0-2009/016222揭示的实施例28相当于N-(1-苯并呋喃-2-基甲基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺。

[0459] 这些结果表明,依据本发明的各个化合物的生物活性比WO-2009/016222所揭示的结构上最接近的化合物好得多。

[0460] 在相同条件下,化合物10在活性成分剂量为500ppm的情况下观察到完全保护,而专利申请CN-1188764中揭示的实施例168的化合物观察到无保护,如表B4所示。

[0461] 表B4:

	实施例	剂量(ppm)	药效
[0462]	本发明的10	500	100
	CN-1188764的168	500	0

[0463] 国际专利CN-1188764中揭示的实施例168相当于5-氯-N-(2-呋喃基甲基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-羧酰胺。

[0464] 这些结果表明,依据本发明的各个化合物的生物活性比CN-1188764所揭示的结构上最接近的化合物好得多。

[0465] 实施例C:对圆核腔菌(Pyrenophora teres)(大麦)的体内预防性测试

[0466] 溶剂:49重量份的N,N-二甲基甲酰胺

[0467] 乳化剂:1重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

[0468] 为了获得活性化合物的合适制剂,将1重量份的活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂进行混合,并用水将浓缩物稀释至所需的浓度。

[0469] 为了测试预防活性,使用活性化合物的制剂在所述施用比率下对幼龄植物进行喷涂。在该处理1天后,用圆核腔菌(Pyrenophora teres)的孢子水性悬浮液对上述植物进行接种。将所述植物在约22℃、相对大气湿度为100%的温育箱中保持48小时。然后将所述植物放在约20℃、相对大气湿度约80%的温室中。

[0470] 在接种7-9天后对测试进行评估。0%表示相当于未处理的对照样的药效,100%的药效表示没有观察到疾病。

[0471] 在这些条件下,使用下表C的化合物在活性成分剂量为500ppm的情况下观察到。