(12) 按照专利合作条约所公布的国际申请

(19) 世界知识产权组织
国 际 局

(43) 国际公布日
2017 年 8 月 3 日 (03.08.2017)

WIPO | PCT

(10) 国际公布号
WO 2017/129122 A1

(51) 国际专利分类号:
C07D 275/03 (2006.01) *A01P 3/00* (2006.01)
A01N 43/80 (2006.01) *A01P 7/04* (2006.01)
A01P 1/00 (2006.01) *A01P 7/02* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2017/072557

(22) 国际申请日: 2017 年 1 月 25 日 (25.01.2017)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
201610058411.5 2016 年 1 月 26 日 (26.01.2016) CN
201610185795.7 2016 年 3 月 25 日 (25.03.2016) CN

(71) 申 请 人: **南 开 大 学** (NANKAI UNIVERSITY) [CN/CN]; 中国天津市南开区卫津路 94 号南开大学元素有机化学国家重点实验室, Tianjin 300071 (CN)。

(72) 发明人: **范志金** (FAN, Zhijin); 中国天津市南开区卫津路 94 号南开大学元素有机化学国家重点实验室, Tianjin 300071 (CN)。 **陈来** (CHEN, Lai); 中国天津市南开区卫津路 94 号南开大学元素有机化学国家重点实验室, Tianjin 300071 (CN)。 **郭晓凤** (GUO, Xiaofeng); 中国天津市南开区卫津路 94 号南开大学元素有机化学国家重点实验室, Tianjin 300071 (CN)。 **朱玉洁** (ZHU, Yujie); 中国天津市南开区卫津路 94 号南开大学元素有机化学国家重点实验室, Tianjin 300071 (CN)。 **钱晓琳** (QIAN, Xiaolin); 中国天津市南开区卫津路 94 号南开大学元素有机化学国家重点实验室, Tianjin 300071 (CN)。 **马刘勇** (MA, Liuyong); 中国天津市南开区卫津路 94 号南开大学元素有机化学国家重点实验室, Tianjin 300071 (CN)。 **张乃楼** (ZHANG, Nailou); 中国天津市南开区卫津路 94 号南开大学元素有机化学国家重点实验室, Tianjin 300071 (CN)。 **王海霞** (WANG, Haixia); 中国天津市南开区卫津路 94 号南开大学元素有机化学国家重点实验室, Tianjin 300071 (CN)。 **张秩鸣** (ZHANG, Zhiming); 中国天津市南开区卫津路 94 号南开大学元素有机化学国家重点实验室, Tianjin 300071 (CN)。 **徐京华** (XU, Jinghua); 中国天津市南开区卫津路 94 号南开大学元素有机化学国家重点实验室, Tianjin 300071 (CN)。 **宋胤奇** (SONG, Yinqi); 中国天津市南开区卫津路 94 号南开大学元素有机化学国家重点实验室, Tianjin 300071 (CN)。

(74) 代理人: **北京路浩知识产权代理有限公司** (CN-KNOWHOW INTELLECTUAL PROPERTY AGENT LIMITED); 中国北京市海淀区丹棱街 3 号 B 座 18 楼 08、09、10、11、17 室, Beijing 100080 (CN)。

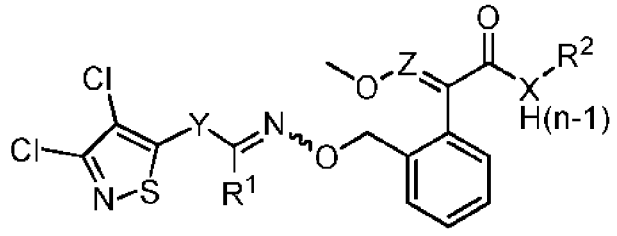
(81) 指定国 (除另有指明，要求每一种可提供的国家保护): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG,

[见续页]

(54) Title: ISOTHIAZOLE OXIME ETHER STROBILURIN DERIVATIVES, PREPARATION METHOD FOR SAME, AND USES THEREOF

(54) 发明名称 : 一类异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物及其制备方法和用途

Ⅳ:



(57) Abstract: Provided in the present invention are isothiazole oxime ether strobilurin derivatives, a preparation method for same, and uses thereof. The present invention relates to 3,4-dichloroisothiazole oxime ether strobilurin derivatives, which have a chemical structural formula as represented by IV. Disclosed are the structural formula of the compounds, a synthesis method for same, and uses thereof as pesticides, fungicides, and antiviral agents for plants, uses of and a preparation method for the derivatives being used in conjunction with agriculturally acceptable excipients or synergists and with commercialized pesticides, fungicides, antiviral agents for plants, and acaricides in prevention and treatment of pests, diseases, viral diseases of plants in agriculture, forestry, and gardening.

(57) 摘要: 本发明提供了一类异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物及其制备方法和用途，本发明涉及 3,4-二氯异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物，它们具有如Ⅳ所示的化学结构通式。本发明公开了上述化合物的结构通式、合成方法与用作杀虫剂、杀菌剂、抗植物病毒剂的用途，其与农业上可接受的助剂或增效剂以及与商品杀虫剂、杀菌剂、抗植物病毒剂、杀螨剂组合使用在防治农业、林业、园艺植物虫害、病害、病毒病害中的用途和制备方法。

WO 2017/129122 A1

BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW。

(84) 指定国 (除另有指明，要求每一种可提供的地区保护): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), 欧洲 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG)。

本国际公布:

— 包括国际检索报告(条约第 21 条(3))。

一类异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物及其制备方法和用途

技术领域

本发明的技术方案涉及含N含S的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯类化合物，具体涉及3,4-二氯异噻唑肟醚类的化合物，即3,4-二氯异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物。

背景技术

杂环化合物是高效、低毒、广谱的生物活性先导化合物，专利文献报道的活性分子大部分具有杂环结构；文献报道五元杂环化合物具有植物激活剂、杀菌剂、植物生长调节剂和杀虫剂的活性(陈丹萍. 现代农药，2014, 14(2): 5-10)，其中，异噻唑是重要的五元含氮含硫杂环化合物。Mel′nikov 发现异噻唑化合物的植物生长调节活性(Mel′nikov N. N., *Zhurnal Vseoyuznogo Khimic heskogo Obshchestva im. D. I. Mendeleeva*. 1988, 33(6), 602-609)。

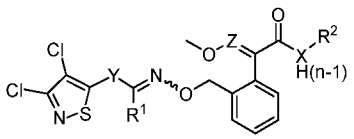
甲氧基丙烯酸酯类杀菌剂具有广谱的杀菌活性，对几乎所有真菌类(子囊菌纲、担子菌纲、卵菌纲和半知菌类)病害都有很好的活性，如麦类的白粉病、叶枯病、赤斑病、网斑病、黑腥病、水稻的稻瘟病、纹枯病及霜霉病和疫病等(关爱莹. 精细与专用化学品，2012, 20(4): 24-28)。该类药剂具备高效、广谱、低毒、内吸和易降解等多种优点，现已成为全球最主要的农用杀菌剂(袁小勇. 2014, 34: 170-177)。已成功商品化的甲氧基丙烯酸酯类杀菌剂中重要的品种主要有：嘧菌酯(azoxystrobin)、醚菌酯(kresoxim-methyl)、吡唑醚菌酯(pyraclostrobin)、肟菌酯(trifloxystrobin)、氟嘧菌酯(fluoxastrobin)、啶氧菌酯(picoxystrobin)、苯氧菌胺(metaminostrobin)、醚菌胺(dimoxystrobin)、肟醚菌胺(orysastrobin)、烯肟菌酯(enestrobin)、唑菌酯(pyraoxystrobin)、烯肟菌胺(SYP-1620)等。由于 Strobilurin 类杀菌剂作用位点单一，大量高频高强度使用带来的抗性问题十分突出(Fisher, N. Pest. Manage. Sci. 2005, 61(10): 973-978)；植物激活剂具有广谱持久的系统获得抗病性，不直接作用于病原物而作用于植物本身，因此，无抗药性的风险，其创制研究迫在眉睫。

为寻找和发现更加高效、广谱、低毒、低生态风险并与现有杀菌剂无交互抗性的农药先导化合物，本发明将含N含S的异噻唑药效团3,4-二氯异噻唑环引入甲氧基丙烯酸酯的先导结构中，设计合成了一类异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物，同时进行了系统的生物活性的筛选和评价，以期为新农药创制研究提供更多的高活性低抗性风险的侯选化合物。

发明内容

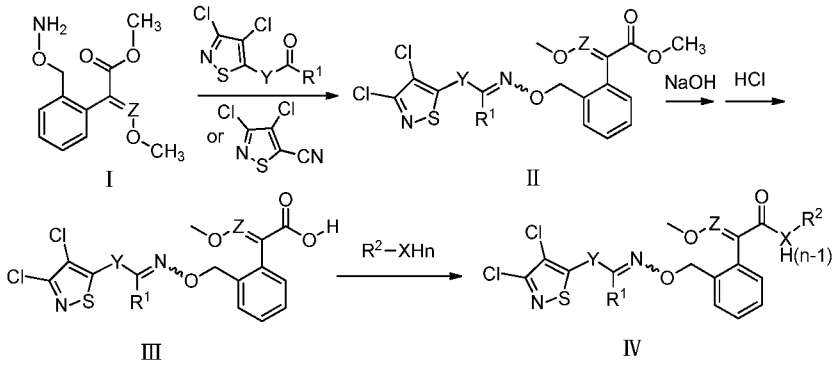
本发明所要解决的技术问题是：提供一类新的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物的合成方法及其调控农业、园艺、卫生和林业植物害虫、植物病原物的生物活性及其测定方法，同时提供这些化合物在农业领域、园艺领域、林业领域以及卫生领域中的应用。

本发明解决该技术问题所采用的技术方案是：具有农业领域、园艺领域、林业领域杀虫、杀螨活性、杀菌活性、抗植物病毒活性、诱导植物产生抗病活性的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯类化合物的化学结构通式见式Ⅳ：

Ⅳ：

其中，R^1 选自：甲基、氢、胺基；R^2 选自：1,2-二氟乙基、炔丙基、环丙基、甲基、1-甲硫基-2-甲基丙-2-基、(R)-1-甲硫基丙-2-基；X 选自：氧、氮，n=1, 2；Y 选自：$CHOH-CH_2$, $CHO-CH_2$, $(CH=CH)_m$, m=0,1；Z 选自：碳、氮。

本发明的3,4-二氯异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ的合成方法如下：



其中，R^1 选自：甲基、氢、胺基；R^2 选自：1,2-二氟乙基、炔丙基、环丙基、甲基、1-甲硫基-2-甲基丙-2-基、(R)-1-甲硫基丙-2-基；X 选自：氧、氮，n=1, 2；Y 选自：$CHOH-CH_2$, $CHO-CH_2$, $(CH=CH)_m$, m=0,1；Z 选自：碳、氮。

优选地，所述的噻二唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物的合成方法分为以下步骤：

A.化合物Ⅱ的制备：

在25毫升单口圆底烧瓶中加入1.10毫摩尔将化合物**Ⅰ**、3,4-二氯异噻唑-5-取代羰基化合物和盐酸分别加入乙醇溶液中，在室温下反应，反应完全后减压除去溶剂，将残余物纯化，即得所述化合物Ⅱ；其中，所述3,4-二氯异噻唑-5-取代羰基化合物选自：3,4-二氯异噻唑-5-甲醛、3,4-二氯异噻唑-5-乙酮、4-(3,4-二氯异噻唑-5-基)-丁-3-烯-2-酮；

或B. 化合物Ⅱ的制备：

将化合物**Ⅰ**、3,4-二氯异噻唑-5-甲氰与巯基乙酸分别加入乙醇溶液中，在室温下反应，反应完全后将反应液浓缩，将残余物纯化，即得所述化合物Ⅱ；

C.化合物Ⅲ的制备方法：

将化合物Ⅱ与氢氧化钠加入甲醇溶液中，然后加热回流进行反应，反应完全后将反应液浓缩，残余物用乙酸乙酯稀释，然后加入水将残余物溶解，分离出水层，然后将水层用盐酸调节pH至3，然后用乙酸乙酯萃取，水层用乙酸乙酯反萃一遍，合并有机层，有机层用饱和氯化钠洗，无水硫酸钠干燥，抽滤，减压除去溶剂，即得化合物Ⅲ；

D.化合物Ⅳ的制备方法:

将化合物Ⅲ、EDCI与HOBT加入至二氯甲烷中，在室温反应，然后向反应体系中加入R^2-XH_n，n=1,2，室温下继续反应，反应完全后，反应液用水洗两遍，分离出有机层，有机层分别用饱和碳酸氢钠和饱和氯化钠洗，无水硫酸钠干燥，抽滤，减压除去溶剂，将残余物纯化，即得到所述化合物Ⅳ。

作为一个优选的实施方案，本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物的合成方法分为以下步骤:

A.化合物Ⅱ的制备方法一:

在25毫升单口圆底烧瓶中加入1.10毫摩尔化合物**I**，用15毫升乙醇溶解，再加入1.00毫摩尔 3,4-二氯异噻唑-5-取代羰基化合物，所述 3,4-二氯异噻唑-5-取代羰基化合物选自:3,4-二氯异噻唑-5-甲醛、3,4-二氯异噻唑-5-乙酮、4-(3,4-二氯异噻唑-5-基)-丁-3-烯-2-酮，最后向反应体系中滴加两滴2摩尔/升的盐酸，室温搅拌12小时，反应完全后减压除去溶剂，残余物经200～300目硅胶柱层析纯化得化合物Ⅱ，洗脱剂为60～90摄氏度的石油醚:乙酸乙酯，根据产物的不同，体积比为9:1-2:1，收率70-80%；化合物Ⅱ制备的量和反应容器的体积按相应比例扩大或缩小。

B.化合物Ⅱ的制备方法二:

在50毫升单口圆底烧瓶中加入1.43毫摩尔化合物**I**，加入20毫升的乙醇，再向反应体系中加入0.20克，即1.10毫摩尔的3,4-二氯异噻唑-5-甲氰，然后加入0.10克的巯基乙酸，室温搅拌过夜，反应结束后将反应液浓缩，残余物经200～300目硅胶柱层析纯化得到白色固体，洗脱剂为60～90摄氏度的石油醚:乙酸乙酯，体积比为10:1，收率97%；化合物Ⅱ制备的量和反应容器的体积按相应比例扩大或缩小。

C.化合物III的制备:

在25毫升单口圆底烧瓶中加入0.24毫摩尔化合物Ⅱ，用15毫升甲醇溶解，向反应中加入0.03克，即0.72毫摩尔氢氧化钠，然后加热回流30分钟，反应结束后将反应液浓缩，残余物用10毫升乙酸乙酯稀释，加入10毫升的水将固体全部溶解，分离出水层，水层用2摩尔/升的盐酸调节pH至3，然后用乙酸乙酯萃取，水层用乙酸乙酯反萃一遍，合并有机层，有机层用饱和氯化钠洗一遍，无水硫酸钠干燥，抽滤，减压除去溶剂，得化合物Ⅲ；收率95-100%；化合物Ⅲ制备的量和反应容器的体积按相应比例扩大或缩小。

D.化合物Ⅳ的制备:

在25毫升单口圆底烧瓶中加入0.30毫摩尔化合物Ⅲ，用15毫升干燥的二氯甲烷溶解，向反应中加入0.69克，即0.36毫摩尔EDCI，即1-乙基-(3-二甲基氨基丙基)碳二亚胺盐酸盐和0.43克，即0.32毫摩尔的HOBT，即1-羟基苯并三氮唑，加完之后室温搅拌30分钟，然后向反应体系中加入0.32毫摩尔的R^2-XH_n，n=1,2，室温搅拌2小时，反应结束后，反应

液用 15 毫升的水洗两遍，分离出有机层，有机层用饱和碳酸氢钠和饱和氯化钠各洗一遍，无水硫酸钠干燥，抽滤，减压除去溶剂，残余物经 200～300 目硅胶柱层析纯化得到白色固体，洗脱剂为 60～90 摄氏度的石油醚:乙酸乙酯，体积比为 4:1，收率 30-95%；化合物Ⅳ制备的量和反应容器的体积按相应比例扩大或缩小。

本发明还提供了所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ在制备杀菌剂、抗烟草花叶病毒剂或植物激活剂中的用途。

本发明还提供了所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与农业上可接受的助剂在制备杀菌剂、抗烟草花叶病毒剂或植物激活剂中的用途。

本发明还提供了所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ在防治农业和林业以及园艺植物虫害中的用途。

优选地，所述异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与农业化学品共同施用；优选地，所述农业化学品选自：杀虫剂、杀菌剂、抗植物病毒剂、杀螨剂中的一种或几种。

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与所述杀虫剂中的任意一种或两种组合形成杀虫组合物用于防治农业和林业以及园艺植物虫害；

优选地，所述杀虫剂选自：毒死蜱、地亚农、啶虫脒、甲氨基阿维菌素、弥拜菌素、阿维菌素、多杀菌素、氰戊菊酯、高效氰戊菊酯、氯氰菊酯、高效氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯、溴氰菊酯、甲氰菊酯、Beta-氟氯氰菊酯、Lambda-三氟氯氰菊酯、二氯苯醚菊酯、苄氯菊酯、丙烯菊酯、联苯菊酯、氯菊酯、醚菊酯、氟氯苯菊酯、氯氟胺氰戊菊酯、吡虫啉、烯啶虫胺、氯噻啉、噻虫啉、噻虫嗪、噻虫胺、呋虫胺、可尼丁、达特南、除虫脲、灭幼脲、伏虫隆、除虫隆、氟铃脲、氟虫脲、啶虫隆、虱螨脲、毒虫脲、氟幼脲、Noviflumuron 即多氟脲，其 CAS 号为 121451-02-3、氟螨脲、Novaluron 即双苯氟脲、氟啶脲、Bay sir 6874 即 1-[(3. 5-二氯-4) 4-硝基苯氧基苯基 3-3-(2-氯苯)-脲、Bay SIR-8514 即 1-(4-三氟甲氧基苯基)-3-(2-氯苯)-脲、嗪虫脲、Bistrifluron 即双三氟虫脲、呋喃虫酰肼、虫酰肼、氯虫酰肼、甲氧虫酰肼、环虫酰肼、乐果、氧化乐果、敌敌畏、乙酰甲胺磷、三唑磷、喹硫磷、哒嗪硫磷、氯唑磷、叶蝉散、西维因、抗蚜威、速灭威、异丙威、杀螟丹、仲丁威、叶飞散、甲萘威、丙硫克百威、丁硫克百威、杀螟丹、溴螨酯、噻螨酮、唑螨酯、哒螨酮、四螨嗪、炔螨特、丁醚脲、吡蚜酮、螺螨酯、螺虫酯、螺虫乙酯、丁烯氟虫腈、三唑锡、噻嗪酮、灭线磷、氟虫腈、杀虫单、杀虫双、氯虫酰胺、氟虫酰胺、氟氰虫酰胺、氰虫酰胺、唑虫酰胺、溴虫腈、吡嗪酮、乙螨唑、吡螨胺、哒幼酮、吡丙醚、埃玛菌素；

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ在所述杀虫组合物中的质量百分含量是 1%-90%；

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与所述杀虫剂的比例为质量百分

比 1%:99%到 99%:1%;

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

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

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

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与所述杀菌剂中的任意一种或两种组合形成杀菌组合物用于防治农业和林业以及园艺植物病害，

优选地，所述杀菌剂选自：苯并噻二唑、噻酰菌胺，简写为 TDL、噻酰胺、甲噻诱胺、4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-甲酸、4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-甲酸钠、4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-甲酸乙酯、DL-β-氨基丁酸、异噻菌胺，其英文通用名为：isotianil、3,4-二氯异噻唑-5-甲酸、3,4-二氯异噻唑-5-甲酸钠、3,4-二氯异噻唑-5-甲酸乙酯、病毒唑、安托芬、宁南霉素或水杨酸、霜脲氰、福美双、福美锌、代森锰锌、乙磷铝、甲基硫菌灵、百菌清、敌可松、腐霉利、苯锈啶、甲基托布津、托布津、精甲霜灵、氟吗啉、烯酰吗啉、高效甲霜灵、高效苯霜灵、双氯氰菌胺、磺菌胺、甲磺菌胺、噻氟菌胺、氟酰胺、叶枯酞、环丙酰菌胺、环氟菌胺、环酰菌胺、氰菌胺、硅噻菌胺、呋吡菌胺、吡噻菌胺、双炔酰菌胺、苯酰菌胺、甲呋酰胺、萎锈灵、乙菌利、异菌脲、嘧菌酯、醚菌胺、氟嘧菌酯、醚菌酯、苯氧菌胺、肟醚菌胺、啶氧菌酯、唑菌胺酯、肟菌酯、烯肟菌酯、烯肟菌胺、氧环唑、糠菌唑、环丙唑醇、苯醚甲环唑、烯唑醇、高效烯唑醇、氟环唑、腈苯唑、氟喹唑、氟硅唑、粉唑醇、己唑醇、亚胺唑、种菌唑、叶菌唑、腈菌唑、戊菌唑、丙环唑、丙硫菌唑、硅氟唑、戊唑醇、四氟醚唑、三唑醇、灭菌唑、联苯三唑醇、噻菌灵、麦穗宁、抑霉唑、高效抑霉唑、咪鲜胺、氟菌唑、氰霜唑、咪唑菌酮、噁咪唑、稻瘟酯、噁唑菌酮、啶菌噁唑、噁霉灵、噁霜灵、噻唑菌胺、土菌灵、辛噻酮、苯噻硫氰、十二环吗啉、丁苯吗啉、十三吗啉、拌种咯、咯菌腈、氟啶胺、啶斑肟、环啶菌胺、啶酰菌胺、氟啶酰菌胺、啶菌胺、嘧菌环胺、氟嘧菌胺、嘧菌腙、嘧菌胺、嘧霉胺、氯苯嘧啶醇、氟苯嘧啶醇、灭螨猛、二氰蒽醌、乙氧喹啉、羟基喹啉、丙氧喹啉、苯氧喹啉、乙霉威、异丙菌胺、苯噻菌胺、霜霉威、磺菌威、敌瘟磷、异稻瘟净、吡菌磷、甲基立枯磷、灭瘟素、春雷霉素、多抗霉素、多氧霉素、有效霉素、井冈霉素、链霉素、甲霜灵、呋霜灵、苯霜灵、呋酰胺、灭锈胺、多菌灵、苯菌灵、甲基硫菌灵、三唑酮、乙嘧酚磺酸酯、二甲嘧酚、乙嘧酚、敌菌丹、克菌丹、灭菌丹、乙烯菌核利、氟氯菌核利、菌核净、百菌清、稻瘟灵、稻瘟净、叶枯唑、五氯硝基苯、丙森锌、三乙膦酸铝、硫磺、波尔多液、硫酸铜、氧氯化铜、氧化亚铜、氢氧化铜、苯菌酮、戊菌隆、哒菌酮、四氯苯酞、咯喹酮、螺环菌胺、三环唑、嗪胺灵、多果啶、双胍辛盐、双胍辛胺、氯硝胺、苯磺菌胺、甲苯磺菌胺、吲哚酯、敌磺钠、喹菌酮、烯丙苯噻唑、溴硝醇、碘甲烷、威百亩、敌线酯、棉隆、二氯异丙醚、噻唑磷、硫线磷、丰索磷、虫线磷、苯线磷、灭线磷、除线磷、氯唑磷、丁硫环磷、杀线威、涕灭威、克百威、硫酰氟、二氯丙烯、二氯异烟酸、烯丙异噻唑；

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ在所述杀菌组合物中的总的质量百分含量是 1%-90%，

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与所述杀菌剂的比例为质量百分比 1%:99%到 99%:1%；

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

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

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

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与所述抗病毒药剂中的任意一种或两种组合形成抗病毒组合物用于防治农业和林业以及园艺植物病毒病害；

优选地，所述抗病毒药剂选自：苯并噻二唑、噻酰菌胺，简写为 TDL、异噻菌胺，其英文通用名为：isotianil、4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-甲酸、4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-甲酸钠、4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-甲酸乙酯、3,4-二氯异噻唑-5-甲酸、3,4-二氯异噻唑-5-甲酸钠、3,4-二氯异噻唑-5-甲酸乙酯、DL-β-氨基丁酸、病毒唑、安托芬、宁南霉素、噻酰胺、甲噻诱胺或水杨酸、嘧肽霉素、二氯异烟酸、烯丙异噻唑、井冈羟胺、井冈霉素；

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ在所述抗病毒组合物中的总的质量百分含量是 1%-90%，

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与所述抗植物病毒剂的比例为质量百分比 1%:99%到 99%:1%；

优选地，所述抗病毒组合物加工的剂型选自：种子处理乳剂、水乳剂、微乳剂、悬乳剂、胶囊悬浮剂、水溶性粒剂、细粒剂、可溶性浓剂、毒谷、块状毒饵、粒状毒饵、片状毒饵、浓毒饵、缓释块、静电喷雾剂、水包油乳剂、烟雾罐、烟雾烛、烟雾筒、烟雾棒、烟雾片、烟雾丸、发气剂、油膏、热雾剂、冷雾剂、气雾剂、固/液混合装剂、液/液混合装剂、固/固混合装剂、药漆、微粒剂、追踪粉剂、油悬剂、油分散性粉剂、浓胶剂、泼

浇剂、种衣剂、涂抹剂、成膜油剂、超低容量液剂、蒸汽释放剂；

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

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

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与所述杀螨剂中的任意一种或两种组合形成杀螨组合物用于防治农业和林业以及园艺植物螨害；

优选地，所述杀螨剂选自：三唑锡、三环锡、苯丁锡、三磷锡、毒虫畏、甲基毒虫畏、巴毒磷、敌敌畏、庚烯磷、速灭磷、久效磷、二溴磷、毒死蜱、嘧啶磷、氯甲亚胺硫磷、氧乐果、敌杀磷、乙硫磷、马拉硫磷、虫螨畏、伏杀硫磷、辛硫磷、甲基嘧啶硫磷、喹硫磷、治螟磷、三唑磷、蚜灭多、水胺硫磷、甲胺磷、胺丙畏、氯亚胺硫磷、亚胺硫磷、氟丙菊酯、联苯菊酯、氯氟氰菊酯、精高效氯氟氰菊酯、甲氰菊酯、氟氰戊菊酯、氟氯苯菊酯、氟胺氰菊酯、溴氟菊酯、联苯肼酯、苯硫威、涕灭威、丁酮威、杀线威、抗虫威、久效威、苯菌灵、氯灭杀威、克百威、丁硫克百威、速灭威、蜱虱威、伐虫脒、单甲脒、杀螨脒、双甲脒、杀虫脒、苯甲酸苄酯、溴螨酯、丁氟螨酯、灭螨醌、氟蚜螨、氟虫脲、浏阳霉素、虫螨霉素、苏云金素、杀螨素、浏阳霉素、阿维菌素、多拉菌素、埃普利诺菌素、伊维菌素、赛拉菌素、莫西菌素、除虫菊素、烟碱、苦参碱、印楝素、鱼藤酮、吡螨胺、哒螨酮、唑螨酯、四螨嗪、炔螨特、噻螨酮、螺螨酯、嘧螨酯、杀螨酯、克螨特、哒螨灵；

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ在所述杀螨组合物中的总的质量百分含量是1%-90%，

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与所述杀螨剂的比例为质量百分比1%:99%到99%:1%；

优选地，所述杀螨组合物加工的剂型选自：种子处理乳剂、水乳剂、微乳剂、悬乳剂、胶囊悬浮剂、水溶性粒剂、细粒剂、可溶性浓剂、毒谷、块状毒饵、粒状毒饵、片状毒饵、浓毒饵、缓释块、静电喷雾剂、水包油乳剂、烟雾罐、烟雾烛、烟雾筒、烟雾棒、烟雾片、烟雾丸、发气剂、油膏、热雾剂、冷雾剂、气雾剂、固/液混合装剂、液/液混合装剂、固/固混合装剂、药漆、微粒剂、追踪粉剂、油悬剂、油分散性粉剂、浓胶剂、泼浇剂、种衣

剂、涂抹剂、成膜油剂、超低容量液剂、蒸汽释放剂；

优选地，所述杀螨组合物防治的螨害选自：螨害选自叶螨科、细须螨科、吷线螨、瘿螨科、红叶螨属、瘿螨科的害螨，这些害螨是世界性农业害螨、林业害螨、园艺害螨和卫生害螨；

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

本发明所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ的生物活性测定如下：

E.本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ的杀菌活性测定：

本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯Ⅳ的杀菌或抑菌活性采用菌体生长率测定法，具体步骤为：取1.8毫克样品溶解在2滴N,N-二甲基甲酰胺中，然后用含有一定量吐温20乳化剂的水溶液稀释至500微克/毫升的药剂，将供试药剂在无菌条件下各吸取1毫升于培养皿内，再分别加入9毫升PDA培养基，摇匀后制成50微克/毫升含药平板，以添加1毫升灭菌水的平板做空白对照，用直径4毫米的打孔器沿菌丝外缘切取菌盘，移至含药平板上，呈等边三角形摆放，每处理重复3次，将培养皿放在24±1摄氏度恒温培养箱内培养，待对照菌落直径扩展到2-3厘米后调查各处理菌盘扩展直径，求平均值，与空白对照比较计算相对抑菌率，供试菌种为我国农业生产中田间实际发生的大部分典型植物病原菌的种属，其代号和名称如下：AS：番茄早疫病菌，其拉丁名为：*Alternaria solani*、BC：黄瓜灰霉病菌，其拉丁名为：*Botrytis cinerea*、CA：花生褐斑病菌，其拉丁名为：*Cercospora arachidicola*、GZ：小麦赤霉病菌，其拉丁名为：*Gibberella zeae*、PI：马铃薯晚疫病菌，其拉丁名为：*Phytophthora infestans* (Mont.) de Bary、PP：苹果轮纹病菌，其拉丁名为：*Physalospora piricola*、PS：水稻纹枯病菌，其拉丁名为：*Pellicularia sasakii*、RC：禾谷丝核菌，其拉丁名为：*Rhizoctonia cerealis*、SS：油菜菌核病菌，其拉丁名为：*Sclerotinia sclerotiorum*。

F.本发明的3,4-二氯异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物诱导抗病活性的测定：

异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ的活性筛选方法如下，烟草花叶病毒简写为TMV：

(1). 阳性对照植物激活剂：选择质量纯度纯度大于99.5%的噻酰菌胺为阳性对照的植物激活剂；噻酰菌胺简写为TDL；

(2). 异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ的诱导烟草抗TMV活性的筛选方法：离体直接抗病毒活性的测定采用半叶法进行；活体诱导是将苗龄一致的普通烟，3盆为一组，分别

于接种前 7 天前处理过的烟苗，处理方式包括：喷施供试化合物溶液 2 到 3 次，每次 10 毫升，或土壤处理，每次 10 毫升，测定浓度为 100 微克/毫升，第 7 天于新长出的烟叶上摩擦接种 TMV，将烟苗置于其生长适宜温度及光照下培养 3 天后，检查发病情况，综合病斑数目按下式计算出供试化合物对 TMV 的诱导抗病毒效果，每一处理设 3 次重复，空白对照和标准药剂对照分别选择水和 TDL：

$$R = \frac{CK - I}{CK} \times 100$$

其中，R 为供试化合物对烟草抗 TMV 的诱导效果，单位：%；CK 为清水对照叶片的平均枯斑数，单位：个；I 为经供试化合物诱导处理后叶片的平均枯斑数，单位：个。

本发明的有益效是：对异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ进行了先导优化，并对异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物进行了抑菌活性的筛选。

本发明通过特定制备和生物活性测定实施例更加具体说明异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ的合成与生物活性及应用，所述实施例仅用于具体说明本发明而非限制本发明，尤其是生物活性仅是举例说明，而非限制本专利，具体实施方式如下：

实施例 1：化合物Ⅱ的制备方法一：

在 25 毫升单口圆底烧瓶中加入 1.10 毫摩尔化合物 **I**，用 15 毫升乙醇溶解，再加入 1.00 毫摩尔 3,4-二氯异噻唑-5-取代羰基化合物，所述 3,4-二氯异噻唑-5-取代羰基化合物选自：3,4-二氯异噻唑-5-甲醛、3,4-二氯异噻唑-5-乙酮、4-(3,4-二氯异噻唑-5-基)-丁-3-烯-2-酮，最后反应体系中滴加两滴 2 摩尔/升的盐酸，室温搅拌 12 小时，反应完全后减压除去溶剂，残余物经 200～300 目硅胶柱层析纯化得化合物Ⅱ，洗脱剂为 60～90 摄氏度的石油醚:乙酸乙酯，体积比为 9:1，收率 70-80%；当 R^1 为甲基，Y 为 $(CH=CH)_m$, m=0，Z 为氮时，核磁数据如下：^{1}HNMR($CDCl_3$) δ7.51(s,1H,Ph-H),7.47-7.43(m,2H,Ph-H),7.24-7.20(m,1H,Ph-H),5.23(s,2H,Ph-CH_2),4.06(s,3H,O-CH_3),3.83(s,3H,O-CH_3),2.52(s,3H,N=C-CH_3)。化合物Ⅱ制备的量和反应容器的体积按相应比例扩大或缩小。化合物Ⅱ的理化参数和结构参数见**表 1**。

实施例 2：化合物Ⅱ的制备方法二：

在 25 毫升单口圆底烧瓶中加入 1.10 毫摩尔化合物 **I**，用 15 毫升乙醇溶解，再加入 1.00 毫摩尔 3,4-二氯异噻唑-5-甲氰，最后反应体系中滴加 0.10 克巯基乙酸，室温搅拌 12 小时，反应完全后减压除去溶剂，残余物经 200～300 目硅胶柱层析纯化得化合物Ⅱ，洗脱剂为 60～90 摄氏度的石油醚:乙酸乙酯，根据产物的不同，体积比为 10:1，收率 80-97%；当 R^1 氨基，Y 为$(CH=CH)_m$, m=0，Z 为氮时，核磁数据如下：^{1}HNMR($CDCl_3$) δ7.40-7.30(m,3H,Ph-H),7.13(d,J=6.4Hz,1H,Ph-H),5.18(s,2H,NH_2),4.91(s,2H,Ph-CH_2),3.97(s,3H,O-CH_3),3.79(s,3H,O-CH_3)。化合物Ⅱ制备的量和反应容器的体积按相应比例扩大或缩小。化合物Ⅱ的理化参数和结构

参数见**表 1**。

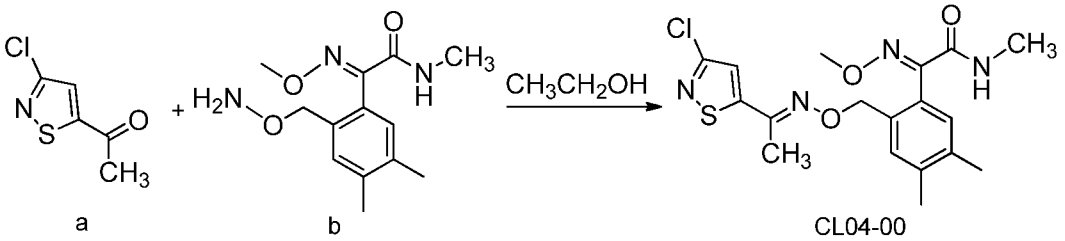
实施例 3：化合物 III 的制备方法：

在 25 毫升单口圆底烧瓶中加入 0.24 毫摩尔化合物Ⅱ，用 15 毫升甲醇溶解，向反应中加入 0.03 克，即 0.72 毫摩尔氢氧化钠，然后加热回流 30 分钟，反应结束后将反应液浓缩，残余物用 10 毫升乙酸乙酯稀释，加入 10 毫升的水将固体全部溶解，分离出水层，水层用 2 摩尔/升的盐酸调节 pH 至 3，然后用乙酸乙酯萃取，水层用乙酸乙酯反萃一遍，合并有机层，有机层用饱和氯化钠洗一遍，无水硫酸钠干燥，抽滤，减压除去溶剂，得白色固体 **III**；收率 95%。化合物 **III** 制备的量和反应容器的体积按相应比例扩大或缩小。化合物 **III** 的理化参数和结构参数见**表 1**。

实施例 4：化合物Ⅳ的制备方法：

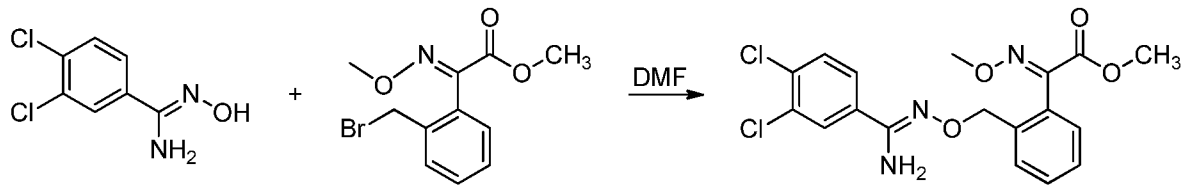
在 25 毫升单口圆底烧瓶中加入 0.30 毫摩尔化合物 **III**，用 15 毫升干燥的二氯甲烷溶解，向反应中加入 0.69 克，即 0.36 毫摩尔 EDCI 和 0.43 克，即 0.32 毫摩尔的 HOBT，加完之后室温搅拌 30 分钟，然后向反应体系中加入 0.32 毫摩尔的 1,2-二氟乙胺，室温搅拌 2 小时，反应结束后，反应液用 15 毫升的水洗两遍，分离出有机层，有机层分别用饱和碳酸氢钠和饱和氯化钠各洗一遍，再无水硫酸钠干燥，抽滤，减压除去溶剂，残余物经 200～300 目硅胶柱层析纯化得到白色固体Ⅳ，洗脱剂为 60～90 摄氏度的石油醚:乙酸乙酯，体积比为 4:1，收率 95%；当 R^1 为甲基，R^2 为 1,2-二氟乙基，X 为氮，Y 为$(CH=CH)_m$, m=0，Z 为氮时，该化合物的核磁数据如下：^{1}HNMR ($CDCl_3$) δ 7.57-7.39(m,3H,Ph-H),7.22(dd,J=6.7,1.9Hz,1H,Ph-H),7.11(s,1H,Ph-H),5.91(tdd,J=55.9,8.6,4.3Hz,1H,CHF_2),5.18(d,J=38.8Hz,2H,Ph-CH_2),4.00(d,J=13.8 Hz,3H,O-CH_3),3.83-3.65(m,2H,N-CH_2),2.42(d,J=72.2Hz,3H,N=C-CH_3)。化合物Ⅳ制备的量和反应容器的体积按相应比例扩大或缩小。化合物Ⅳ的理化参数和结构参数见**表 1**。

实施例 5：化合物 CL04-00 的制备方法：



在 25 毫升单口圆底烧瓶中加入 1.10 毫摩尔化合物 b，用 15 毫升乙醇溶解，再加入 1.00 毫摩尔 3-氯异噻唑-5-乙酮，最后反应体系中滴加两滴 2 摩尔/升的盐酸，室温搅拌 12 小时，反应完全后减压除去溶剂，残余物经 200～300 目硅胶柱层析纯化得化合物 **CL04-00**，洗脱剂为 60～90 摄氏度的石油醚:乙酸乙酯，体积比为 4:1，收率 68.22%。

实施例 6：化合物 CL05-00 的制备方法：



A B CL05-00

为了比较结构与本发明中的化合物结构最接近的化合物之间的活性差异，本发明合成了文献报道的化合物 CL05-00，具体合成步骤如下：

在 25 毫升单口圆底烧瓶中加入 1.00 毫摩尔化合物 A，用 15 毫升 DMF 溶解，再加入 1.50 毫摩尔碳酸铯，最后反应体系中加入 1.5 毫摩尔的化合物 B，室温搅拌 12 小时，反应完全后减压除去溶剂，残余物经 200～300 目硅胶柱层析纯化得化合物 **CL05-00**，洗脱剂为 60～90 摄氏度的石油醚:乙酸乙酯，体积比为 8:1，收率 55.57%。

实施例 7：本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ的抑菌活性测定结果：

本发明测试的常见植物病原真菌的代号和名称如下：AS：番茄早疫病菌，其拉丁名为：*Alternaria solani*、BC：黄瓜灰霉病菌，其拉丁名为：*Botrytis cinerea*、CA：花生褐斑病菌，其拉丁名为：*Cercospora arachidicola*、GZ：小麦赤霉病菌，其拉丁名为：*Gibberella zeae*、PI：马铃薯晚疫病菌，其拉丁名为：*Phytophthora infestans* (Mont.) de Bary、PP：苹果轮纹病菌，其拉丁名为：*Physalospora piricola*、PS：水稻纹枯病菌，其拉丁名为：*Pellicularia sasakii*、RC：禾谷丝核菌，其拉丁名为：*Rhizoctonia cerealis*、SS：油菜菌核病菌，其拉丁名为：*Sclerotinia sclerotiorum*，这些菌种具有很好的代表性，能够代表农业生产中田间发生的大部分病原菌的种属。

值得注意的是本发明中化合物 CL04-00 为专利 WO 2000003974 A1 中报道过的化学结构与本发明目标化合物最接近的已知化合物，为了比较本发明合成的新化合物的生物活性，本发明合成了结构最接近本发明目标化合物的已知化合物 CL04-00 作为对照化合物，并与本发明目标化合物进行活性比较。

菌体生长率法测定结果见**表 2**，**表 2** 表明，在 50 微克/毫升时，本发明合成的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯所有化合物均有不同程度的杀菌活性。对番茄早疫病菌而言，化合物 CL03-49、CL03-50、CL04-03、CL04-04 上、CL04-04 下、CL04-06、CL04-15A、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22A、CL04-22D、CL04-25C、CL04-17、CL04-32A、CL04-32B、CL04-32C 和 CL04-32D 的抑制率均在 30%以上，上述化合物的杀菌活性均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL04-00 的杀菌活性 10%以上，此外化合物 CL03-50、CL04-03、CL04-04 上、CL04-06、CL04-15B、CL04-15C 和 CL04-32D 的杀菌活性均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL05-00 的杀菌活性 10%以上，其中化合物 CL04-04 上、CL04-15B 的抑菌率均在 80%以上，均高出对照药嘧菌酯 10%以上和对照药烯肟菌酯 30%以上，尤其是化合物 CL04-15B 杀菌活性最高，达 100%；化合物对花

生褐斑菌而言，化合物 CL03-49、CL03-50、CL04-04 上、CL04-04 下、CL04-06、CL04-15A、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22A、CL04-22B、CL04-22C、CL04-22D、CL04-22E、CL04-25C、CL04-17、CL04-32A、CL04-32B、CL04-32C 和 CL04-32D 的抑制率均在 30%以上，上述化合物的抑菌活性均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL04-00 的抑菌活性 10%以上，此外化合物 CL04-04 上、CL04-04 下、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22D 和 CL04-32D 的抑制率均在 75%以上，均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL05-00 的杀菌活性 10%以上，均高出对照药嘧菌酯和烯肟菌酯 20%以上，且化合物 CL04-03 和 CL04-15B 的抑制率分别达到了 100%和 91.67%；对小麦赤霉病菌而言，化合物 CL03-49、CL03-50、CL04-03、CL04-04 上、CL04-04 下、CL04-06、CL04-15A、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22A、CL04-22B、CL04-22C、CL04-22D、CL04-22E、CL04-22F、CL04-24、CL04-25A、CL04-25B、CL04-25C、CL04-25E、CL04-17、CL04-32A、CL04-32B、CL04-32C、CL04-32D 和 CL04-32F 的抑制率均在 30%以上，上述化合物的抑菌活性均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL04-00 和对照药烯肟菌酯的抑菌活性 10%以上，其中化合物 CL04-03、CL04-04 上、CL04-04 下、CL04-06、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22A、CL04-22B、CL04-22C、CL04-22D、CL04-25B、CL04-25C、CL04-17、CL04-32B、CL04-32C 和 CL04-32F 的抑菌活性均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL05-00 10%以上，其中化合物 CL04-15C、CL04-22B、CL04-22D、CL04-25C、CL04-32B 和 CL04-32D 的抑制率均在 80%以上，均比对照药嘧菌酯高出 10%以上，尤其化合物 CL04-22B、CL04-22D、CL04-25C 和 CL04-32D 的杀菌最高，达 100%；对苹果轮纹病菌而言，CL03-49、CL03-50、CL04-03、CL04-04 上、CL04-04 下、CL04-06、CL04-15A、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22B、CL04-22C、CL04-22D、CL04-17、CL04-32B、CL04-32C 和 CL04-32D 的抑菌活性均在 45%以上，上述化合物的抑菌活性均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL04-00 的抑菌活性 10%以上，其中化合物 CL03-49、CL03-50、CL04-03、CL04-04 上、CL04-06、CL04-15C、CL04-22D、CL04-32C 的抑制率均在 70%以上，均高出与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL05-00 和对照药烯肟菌酯 10%以上，且化合物 CL04-03 杀菌活性最高，达 86.96%；对黄瓜灰霉病菌的活性测试表明，CL03-49、CL03-50、CL04-03、CL04-04 上、CL04-04 下、CL04-06、CL04-15A、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22A、CL04-22B、CL04-22C、CL04-22D、CL04-22E、CL04-22F、CL04-25C、CL04-17、CL04-32A、CL04-32B、CL04-32C 和 CL04-32D 的杀菌活性均在 45%以上，上述化合物的抑菌活性均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL04-00 的抑菌活性 10%以上，其中化合物 CL03-49、CL03-50、CL04-03、CL04-04 上、CL04-04 下、CL04-06、CL04-15A、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22D 和 CL04-22E 的杀菌活性均高出对照药烯肟菌酯 10%以上，且化合物 CL03-49、CL03-50、CL04-03、CL04-04 上、CL04-06、CL04-15A、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22D 和 CL04-17 抑制率达到了 100%，

均高于文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL05-00 的抑菌活性 25%以上且高于对照药嘧菌酯的杀菌活性；对油菜菌核病菌的活性测试表明，化合物 CL03-49、CL03-50、CL04-03、CL04-04 上、CL04-04 下、CL04-06、CL04-15A、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22A、CL04-22B、CL04-22C、CL04-22D、CL04-22F、CL04-25A、CL04-25B、CL04-25C、CL04-25D、CL04-25E、CL04-17、CL04-32A、CL04-32B、CL04-32C、CL04-32D 和 CL04-32F 的抑制率均在 40%以上，上述化合物的抑菌活性均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL04-00 的抑菌活性 10%以上,化合物 CL03-49、CL03-50、CL04-03、CL04-04 上、CL04-04 下、CL04-06、CL04-15A、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22A、CL04-22B、CL04-22C、CL04-22D、CL04-25C、CL04-17、CL04-32B、CL04-32C 和 CL04-32D 的杀菌活性均高出对照药烯肟菌酯 10%以上,且化合物 CL04-03、CL04-04 上、CL04-06、CL04-15A、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22B、CL04-22D 的抑制率均高于 90%，均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL05-00 的抑菌活性 20%以上且高于对照药嘧菌酯，尤其是化合物 CL04-03、CL04-06、CL04-15A、CL04-22B、CL04-22D 的抑制率最高，达 100%；对禾谷丝核菌而言，化合物 CL03-49、CL03-50、CL04-03、CL04-04 上、CL04-04 下、CL04-06、CL04-15A、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22A、CL04-22B、CL04-22C、CL04-22D、CL04-22E、CL04-22F、CL04-24、CL04-25A、CL04-25B、CL04-25C、CL04-25E、CL04-17、CL04-32A、CL04-32B、CL04-32C、CL04-32D 和 CL04-32F 的抑制率均在 50%以上，上述化合物的抑菌活性均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL04-00 的抑菌活性 40%以上，其中化合物 CL03-49、CL03-50、CL04-03、CL04-04 上、CL04-06、CL04-15B、CL04-22D、CL04-25C 和 CL04-32B 的抑制率均达 90%以上，均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL05-00 的抑菌活性 10%以上且均高出对照药嘧菌酯 10%以上和烯肟菌酯 20%以上,且化合物 CL03-49、CL03-50、CL04-03、CL04-04 上和 CL04-06 的抑制率最高，达 100%；对水稻纹枯病菌而言，化合物 CL03-49、CL03-50、CL04-03、CL04-04 上、CL04-04 下、CL04-06、CL04-15A、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22B、CL04-22C、CL04-22B、CL04-25A、CL04-25C、CL04-17、CL04-32A、CL04-32B、CL04-32C 和 CL04-32D 的抑制率均在 35%以上，上述化合物的抑菌活性均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL04-00 的抑菌活性 10%以上，其中化合物 CL04-06、CL04-15A、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22B、CL04-22D、CL04-25C、CL04-32B、CL04-32C 和 CL04-32D 的抑菌活性均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL05-00 的抑菌活性 10%以上且均高出对照药烯肟菌酯 10%以上，且化合物 CL04-22D、CL04-25C 和 CL04-32D 的抑制率均在 80%以上，均高于对照药嘧菌酯；对于马铃薯晚疫病菌的活性表明，化合物 CL03-49、CL03-50、CL04-03、CL04-04 上、CL04-04 下、CL04-06、CL04-15A、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22A、CL04-22B、CL04-22C、CL04-22D、CL04-25A、CL04-25C、CL04-17、CL04-32A、CL04-32B、CL04-32C 和 CL04-32D 的抑制

率均在 40%以上，上述化合物的抑菌活性均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL04-00 和对照药烯肟菌酯的抑菌活性 10%以上，其中化合物 CL04-03、CL04-04 下、CL04-06、CL04-15A、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22A、CL04-22B、CL04-22C、CL04-22D、CL04-25A、CL04-25C、CL04-32A、CL04-32B、CL04-32C 和 CL04-32D 的抑制率均在 55%以上，均高出对照药嘧菌酯 10%以上，其中化合物 CL04-15B、CL04-15C、CL04-22C、CL04-22D、CL04-25A、CL04-25C、CL04-32A、CL04-32B、CL04-32C 和 CL04-32D 的抑制活性均在 86%以上，均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL05-00 的抑菌活性 10%以上，且化合物 CL04-22C、CL04-22D、CL04-25A、CL04-25C、CL04-32B、CL04-32C 和 CL04-32D 抑制率最高，达 100%；综上可见，化合物 CL04-03、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22D 具有广谱的杀菌活性。

实施例 8：本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ防治黄瓜白粉病的田间试验结果：

本发明对高活性化合物开展了田间药效试验，选择的防治对象的名称及代号如下：白粉病(*Sphaerotheca fuliginea*)；选择的试验作物品种为“津优 40”的黄瓜。施药方法及用水量(升/公顷)：在发病前或者发病初期，采用喷雾法施药。以 675L/hm^2 的药液量对植株均匀喷雾，空白对照喷等量清水。实验结果见**表 3**，**表 3** 表明，9.60%CL04-22D 乳油对黄瓜白粉病的平均防效为 78.62%；而对照药剂 250g/L 嘧菌酯 SC(英国先正达有限公司生产)的平均防效为 70.19%，本发明的化合物的活性高出对照药剂将近 10%；50%肟菌酯(FLINT)WG(德国拜耳作物科学公司生产)的平均防效为 68.02%，肟菌酯的化学结构与本发明专利化合物结构最接近，本发明化合物的活性高出该对照药剂 10%以上。经方差分析和多重比较，9.60%CL04-22D 乳油 37.5 克/公顷的防效显著高于两对照药剂 250g/L 嘧菌酯 SC 和 50%肟菌酯(FLINT)WG 的防效。试验期间观察，9.60%CL04-22D 乳油各处理对黄瓜植株无药害等不良影响。综上所述：9.60%CL04-22D 乳油对黄瓜白粉病有较好的防治效果。

实施例 9：本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ防治黄瓜霜霉病的田间试验结果：

本发明对高活性化合物开展了田间药效试验，选择防治对象的名称及代号如下：黄瓜霜霉病(*Pseudoperponspora cubensis*)；选择的试验作物品种“津绿 3 号”的黄瓜。施药方法及用水量(升/公顷)：在黄瓜霜霉病发病初期，采用喷雾法施药。以 675L/hm^2 的药液量对植株均匀喷雾，空白对照喷等量清水。实验结果见**表 4**，**表 4** 表明，9.60%CL04-22D 乳油对黄瓜霜霉病的平均防效为 79.18%；而对照药剂 50%肟菌酯(FLINT)WG(德国拜耳作物科学公司生产)的平均防效为 72.02%，本发明的化合物的活性高出对照药剂 5%以上；250g/L 吡唑醚菌酯 EC(巴斯夫植物保护(江苏)有限公司生产)的平均防效为 77.52%，本发明的化合物的活性与该对照药剂相当。经方差分析和多重比较，9.60% CL04-22D 乳油 75 克/公顷的防效与对照药剂 250g/L 吡唑醚菌酯 EC 的防效相当，无显著差异；但显著高于化学结构与本发明专利化合物最接近的对照药剂 50%肟菌酯 WG 的平均防效。试验期间观察，9.60%CL04-22D 乳油对黄瓜植株无药害等不良影响。综上所述：9.60%CL04-22D 乳油对黄瓜霜霉病有较好的防

治效果。

实施例 10：本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ的抗烟草花叶病毒(简称 TMV)活性：

抗 TMV 活性的测定结果见**表 5**，**表 5** 表明，本发明的大部分化合物具有较好的抗 TMV 的活性；在 100 微克/毫升时，本发明合成的所有化合物均有不同程度的抗 TMV 活性。在治疗模式下，化合物 CL03-49、CL04-50、CL04-03、CL04-25A、CL04-25D、CL04-17、CL04-32B 和 CL04-32F 抗烟草花叶病毒活性均在 30%以上，其中化合物 CL03-49、CL04-50、CL04-03、CL04-25A、CL04-32B 和 CL04-32F 的抗烟草花叶病毒活性均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL04-00、CL05-00 和异噻菌胺 10%以上，且化合物 CL04-32F 的抗烟草花叶病毒活性在 60%以上，尤其是化合物 CL04-25A 和 CL04-32B 抗烟草花叶病毒活性高于对照药宁南霉素；在钝化模式下，化合物 CL03-49、CL03-50、CL04-03、CL04-04 上、CL04-04 下、CL04-15A、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22A、CL04-22B、CL04-22E、CL04-17、CL04-32A、CL04-32B、CL04-32C 和 CL04-32D 抗烟草花叶病毒活性均在 30%以上，上述化合物的抗烟草花叶病毒活性均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL04-00、CL05-00 和异噻菌胺 10%以上，其中化合物 CL03-50、CL04-04 上和 CL04-32B 的钝化抑制率均在 70%以上，与对照药病毒唑的钝化抑制率相当，且化合物 CL04-03 的钝化抑制率最高，达 80%以上；在保护模式下，化合物 CL03-50、CL04-04 上、CL04-04 下、CL04-06、CL04-15A、CL04-22B、CL04-22D、CL04-25A、CL04-25C、CL04-32A、CL04-32E 和 CL04-32F 的保护效果均在 40%，上述化合物的抗烟草花叶病毒活性均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL04-00、CL05-00 和异噻菌胺 10%以上，其中化合物 CL03-50、CL04-04 上、CL04-06、CL04-22B、CL04-25C 和 CL04-32F 的保护活性均在 50%以上；在诱导模式下，化合物 CL03-49、CL03-50、CL04-03、CL04-04 上、CL04-04 下、CL04-06、CL04-15A、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22A、CL04-22B、CL04-22C、CL04-22D、CL04-22F、CL04-24、CL04-25A、CL04-25C、CL04-17、CL04-32A、CL04-32B、CL04-32D 和 CL04-32F 的诱导效果均在 30%以上，上述化合物的抗烟草花叶病毒活性均高出文献报道的与本发明目标化合物化学结构最接近的化合物 CL04-00 和 CL05-00 10%以上，其中化合物 CL03-49、CL03-50、CL04-03、CL04-04 上 CL04-06、CL04-15A、CL04-15B、CL04-15C、CL04-22C、CL04-22D、CL04-25A、CL04-32B、CL04-32E 的诱导活性在 70%以上，尤其是化合物 CL03-50、CL04-15C、CL04-22C 的诱导活性达到了 80%，高于对照药 TDL、BTH、SZG-7 和异噻菌胺；在诱导模式下，上述的化合物表现了良好的诱导活性。可见，化合物 CL04-04 上和 CL04-32B 对 TMV 具有良好的抑制活性。本发明的大部分化合物具有很好的抗 TMV 的活性。

本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ还对水稻矮缩病、黄矮病、条纹叶枯病、番茄蕨叶病毒病、辣椒花叶病毒病、烟草脉坏死病毒病、玉米矮花叶病、花椰菜花叶病毒、

柑橘病毒病、建兰花叶病毒病、建兰环斑病毒的农业和林业以及园艺植物病毒病害具有很好的抗病毒活性。

实施例 11：本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与杀虫剂组合在防治农业和林业以及园艺植物虫害中的应用：

本发明的所有异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与商品杀虫剂中的任意一种或两种组合形成杀虫组合物用于防治农业和林业以及园艺植物虫害，所述商品杀虫剂选自：毒死蜱、地亚农、啶虫脒、甲氨基阿维菌素、弥拜菌素、阿维菌素、多杀菌素、氰戊菊酯、高效氰戊菊酯、氯氰菊酯、高效氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯、溴氰菊酯、甲氰菊酯、Beta-氟氯氰菊酯、Lambda-三氟氯氰菊酯、二氯苯醚菊酯、苄氯菊酯、丙烯菊酯、联苯菊酯、氯菊酯、醚菊酯、氟氯苯菊酯、氯氟胺氰戊菊酯、吡虫啉、烯啶虫胺、氯噻啉、噻虫啉、噻虫嗪、噻虫胺、呋虫胺、可尼丁、达特南、除虫脲、灭幼脲、伏虫隆、除虫隆、氟铃脲、氟虫脲、啶虫隆、虱螨脲、毒虫脲、氟幼脲、Noviflumuron 即多氟脲，其 CAS 号为 121451-02-3、氟螨脲、Novaluron 即双苯氟脲、氟啶脲、Bay sir 6874 即{1-[(3. 5-二氯-4) 4-硝基苯氧基苯基 3-3-(2-氯苯)-脲}、Bay SIR-8514 即[1-(4-三氟甲氧基苯基)-3-(2-氯苯)-脲]、嗪虫脲、Bistrifluron 即双三氟虫脲、呋喃虫酰肼、虫酰肼、氯虫酰肼、甲氧虫酰肼、环虫酰肼、乐果、氧化乐果、敌敌畏、乙酰甲胺磷、三唑磷、喹硫磷、哒嗪硫磷、氯唑磷、叶蝉散、西维因、抗蚜威、速灭威、异丙威、杀螟丹、仲丁威、叶飞散、甲萘威、丙硫克百威、丁硫克百威、杀螟丹、溴螨酯、噻螨酮、唑螨酯、哒螨酮、四螨嗪、炔螨特、丁醚脲、吡蚜酮、螺螨酯、螺虫酯、螺虫乙酯、丁烯氟虫腈、三唑锡、噻嗪酮、灭线磷、氟虫腈、杀虫单、杀虫双、氯虫酰胺、氟虫酰胺、氟氰虫酰胺、氰虫酰胺、唑虫酰胺、溴虫腈、吡嗪酮、乙螨唑、吡螨胺、哒幼酮、吡丙醚、埃玛菌素；本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ在所述杀虫组合物中的质量百分含量是 1%-90%，本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与前述商品杀虫剂的比例为质量百分比 1%:99%到 99%:1%；所述杀虫组合物加工的剂型选自：种子处理乳剂、水乳剂、微乳剂、悬乳剂、胶囊悬浮剂、水溶性粒剂、细粒剂、可溶性浓剂、毒谷、块状毒饵、粒状毒饵、片状毒饵、浓毒饵、缓释块、静电喷雾剂、水包油乳剂、烟雾罐、烟雾烛、烟雾筒、烟雾棒、烟雾片、烟雾丸、发气剂、油膏、热雾剂、冷雾剂、气雾剂、固/液混合装剂、液/液混合装剂、固/固混合装剂、药漆、微粒剂、追踪粉剂、油悬剂、油分散性粉剂、浓胶剂、泼浇剂、种衣剂、涂抹剂、成膜油剂、超低容量液剂、蒸汽释放剂；所述杀虫组合物防治的植物虫害选自：红蜘蛛、东亚飞蝗、云斑车蝗、中华稻蝗、日本黄脊蝗、单刺蝼蛄、东方蝼蛄、稻蓟马、烟蓟马、温室蓟马、稻管蓟马、麦简管蓟马、温室白粉虱、烟粉虱、黑尾叶蝉、大青叶蝉、棉叶蝉、斑衣蜡蝉、褐飞虱、白背飞虱、灰飞虱、甘蔗扁角飞虱、棉蚜、麦二叉蚜、麦长管蚜、桃蚜、高粱蚜、萝卜蚜、吹绵蚧、桑盾蚧、矢尖盾蚧、梨圆蚧、白蜡虫、红蜡蚧、朝鲜球坚蚧、梨网蝽、香蕉网蝽、细角花蝽、微小花蝽、针缘蝽、稻蛛缘蝽、稻褐蝽、稻黑蝽、稻绿蝽、绿盲蝽、苜蓿盲蝽、中黑盲蝽、

大草蛉、丽草蛉、中华草蛉、谷蛾、衣蛾、黄刺蛾、褐刺蛾、扁刺蛾、麦蛾、棉红铃虫、甘薯麦蛾、小菜蛾、桃小食心虫、大豆食心虫、桃小食心虫、苹果顶梢卷叶蛾、褐带长卷叶蛾、拟小黄卷叶蛾、二化螟、豆荚螟、玉米螟、三化螟、菜螟、稻纵卷叶螟、条螟、棉卷叶野螟、桃蛀螟、黏虫、斜纹夜蛾、稻螟蛉、棉小造桥虫、甜菜夜蛾、大螟、棉铃虫、鼎点金刚钻、小地老虎、大地老虎、黄地老虎、盗毒蛾、舞毒蛾、甘薯天蛾、豆天蛾、直纹稻弄蝶、隐纹谷弄蝶、柑橘凤蝶、玉带凤蝶、菜粉蝶、苎麻赤蛱蝶、苎麻黄蛱蝶、豆芜菁、金星步甲、皱鞘步甲、麦穗步甲、沟金针虫、细胸金针虫、谷斑皮蠹、黑皮蠹、柑橘小吉丁虫、金缘吉丁虫、黄粉虫、黑粉虫、赤拟谷盗、杂拟谷盗、铜绿异丽金龟、暗黑金龟、华北大黑鳃金龟、桑天牛、星天牛、橘褐天牛、桃红颈天牛、大猿叶虫、小猿叶虫、黄守瓜、黄曲条跳甲、绿豆象、豌豆象、蚕豆象、玉米象、米象、小麦叶蜂、梨实蜂、黄带姬蜂、黏虫白星姬蜂、螟蛉悬茧姬蜂、棉铃虫齿唇姬蜂、螟黑点疣姬蜂、蚊、蝇、虻、麦红吸浆虫、麦黄吸浆虫、稻瘿蚊、柑橘大实蝇、瓜实蝇、麦叶灰潜蝇、美洲斑潜蝇、豆秆黑潜蝇、麦秆蝇、种蝇、葱蝇、萝卜蝇、伞裙追寄蝇、玉米螟厉寄蝇、黏虫；所述杀虫组合物防治的植物选自：稻谷、小麦、大麦、燕麦、玉米、高粱、甘薯、马铃薯、木薯、大豆、荷兰豆、蚕豆、豌豆、绿豆、小豆、棉花、蚕桑、花生、油菜、芝麻、向日葵、甜菜、甘蔗、咖啡、可可、人参、贝母、橡胶、椰子、油棕、剑麻、烟草、番茄、辣椒、萝卜、黄瓜、白菜、芹菜、榨菜、甜菜、油菜、葱、大蒜、西瓜、甜瓜、哈密瓜、木瓜、苹果、柑桔和桃树、茶、山野菜、竹笋、啤酒花、胡椒、香蕉、番木瓜、兰花、盆景。

实施例 12：本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与杀菌剂组合在防治农业和林业以及园艺植物病害中的应用：

本发明的所有异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与商品杀菌剂中的任意一种或两种组合形成杀菌组合物用于防治农业和林业以及园艺植物病害，所述商品杀菌剂选自：苯并噻二唑、噻酰菌胺，简写为 TDL、噻酰胺、甲噻诱胺、4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-甲酸、4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-甲酸钠、4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-甲酸乙酯、DL-β-氨基丁酸、异噻菌胺，其英文通用名为：isotianil、3,4-二氯异噻唑-5-甲酸、3,4-二氯异噻唑-5-甲酸钠、3,4-二氯异噻唑-5-甲酸乙酯、病毒唑、安托芬、宁南霉素或水杨酸、霜脲氰、福美双、福美锌、代森锰锌、乙磷铝、甲基硫菌灵、百菌清、敌可松、腐霉利、苯锈啶、甲基托布津、托布津、精甲霜灵、氟吗啉、烯酰吗啉、高效甲霜灵、高效苯霜灵、双氯氰菌胺、磺菌胺、甲磺菌胺、噻氟菌胺、氟酰胺、叶枯酞、环丙酰菌胺、环氟菌胺、环酰菌胺、氰菌胺、硅噻菌胺、呋吡菌胺、吡噻菌胺、双炔酰菌胺、苯酰菌胺、甲呋酰胺、萎锈灵、乙菌利、异菌脲、嘧菌酯、醚菌胺、氟嘧菌酯、醚菌酯、苯氧菌胺、肟醚菌胺、啶氧菌酯、唑菌胺酯、肟菌酯、烯肟菌酯、烯肟菌胺、氧环唑、糠菌唑、环丙唑醇、苯醚甲环唑、烯唑醇、高效烯唑醇、氟环唑、腈苯唑、氟喹唑、氟硅唑、粉唑醇、己唑醇、亚胺唑、种菌唑、叶菌唑、腈菌唑、戊菌唑、丙环唑、丙硫菌唑、硅氟唑、戊唑醇、四氟醚唑、三唑醇、灭菌唑、联苯三唑醇、

噻菌灵、麦穗宁、抑霉唑、高效抑霉唑、咪鲜胺、氟菌唑、氰霜唑、咪唑菌酮、噁咪唑、稻瘟酯、噁唑菌酮、啶菌噁唑、噁霉灵、噁霜灵、噻唑菌胺、土菌灵、辛噻酮、苯噻硫氰、十二环吗啉、丁苯吗啉、十三吗啉、拌种咯、咯菌腈、氟啶胺、啶斑肟、环啶菌胺、啶酰菌胺、氟啶酰菌胺、啶菌胺、嘧菌环胺、氟嘧菌胺、嘧菌腙、嘧菌胺、嘧霉胺、氯苯嘧啶醇、氟苯嘧啶醇、灭螨猛、二氰蒽醌、乙氧喹啉、羟基喹啉、丙氧喹啉、苯氧喹啉、乙霉威、异丙菌胺、苯噻菌胺、霜霉威、磺菌威、敌瘟磷、异稻瘟净、吡菌磷、甲基立枯磷、灭瘟素、春雷霉素、多抗霉素、多氧霉素、有效霉素、井冈霉素、链霉素、甲霜灵、呋霜灵、苯霜灵、呋酰胺、灭锈胺、多菌灵、苯菌灵、甲基硫菌灵、三唑酮、乙嘧酚磺酸酯、二甲嘧酚、乙嘧酚、敌菌丹、克菌丹、灭菌丹、乙烯菌核利、氟氯菌核利、菌核净、百菌清、稻瘟灵、稻瘟净、叶枯唑、五氯硝基苯、丙森锌、三乙膦酸铝、硫磺、波尔多液、硫酸铜、氧氯化铜、氧化亚铜、氢氧化铜、苯菌酮、戊菌隆、哒菌酮、四氯苯酞、咯喹酮、螺环菌胺、三环唑、嗪胺灵、多果啶、双胍辛盐、双胍辛胺、氯硝胺、苯磺菌胺、甲苯磺菌胺、吲哚酯、敌磺钠、喹菌酮、烯丙苯噻唑、溴硝醇、碘甲烷、威百亩、敌线酯、棉隆、二氯异丙醚、噻唑磷、硫线磷、丰索磷、虫线磷、苯线磷、灭线磷、除线磷、氯唑磷、丁硫环磷、杀线威、涕灭威、克百威、硫酰氟、二氯丙烯、二氯异烟酸、烯丙异噻唑；本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ在所述杀菌组合物中的总的质量百分含量是1%-90%，本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与前述商品杀菌剂的比例为质量百分比 1%:99%到 99%:1%；所述杀菌组合物加工的剂型选自：种子处理乳剂、水乳剂、微乳剂、悬乳剂、胶囊悬浮剂、水溶性粒剂、细粒剂、可溶性浓剂、毒谷、块状毒饵、粒状毒饵、片状毒饵、浓毒饵、缓释块、静电喷雾剂、水包油乳剂、烟雾罐、烟雾烛、烟雾筒、烟雾棒、烟雾片、烟雾丸、发气剂、油膏、热雾剂、冷雾剂、气雾剂、固/液混合装剂、液/液混合装剂、固/固混合装剂、药漆、微粒剂、追踪粉剂、油悬剂、油分散性粉剂、浓胶剂、泼浇剂、种衣剂、涂抹剂、成膜油剂、超低容量液剂、蒸汽释放剂；所述杀菌组合物防治的植物病害选自：稻苗绵腐病、番茄根腐病、马铃薯晚疫病、烟草黑胫病、谷子白粉病、葡萄霜霉病、莴苣霜霉病、黄瓜霜霉病、黄瓜炭疽病；所述杀菌组合物适用的植物选自：稻谷、小麦、大麦、燕麦、玉米、高粱、甘薯、马铃薯、木薯、大豆、荷兰豆、蚕豆、豌豆、绿豆、小豆、棉花、蚕桑、花生、油菜、芝麻、向日葵、甜菜、甘蔗、咖啡、可可、人参、贝母、橡胶、椰子、油棕、剑麻、烟草、番茄、辣椒、萝卜、黄瓜、白菜、芹菜、榨菜、甜菜、油菜、葱、大蒜、西瓜、甜瓜、哈密瓜、木瓜、苹果、柑桔和桃树、茶、山野菜、竹笋、啤酒花、胡椒、香蕉、番木瓜、兰花、盆景。

实施例 13：本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与抗植物病毒剂组合在防治农业和林业以及园艺植物病毒病害中的应用：

本发明的所有异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与商品抗病毒药剂中的任意一种或两种组合形成抗病毒组合物用于防治农业和林业以及园艺植物病毒病害，所述商品抗病毒

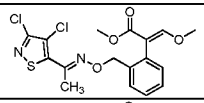
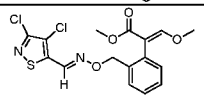
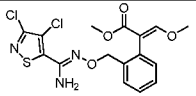
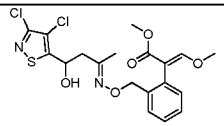
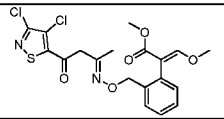
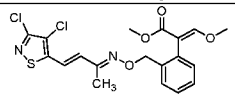
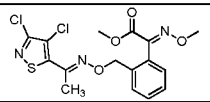
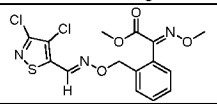
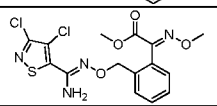
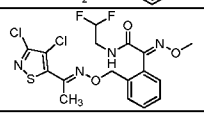
药剂选自：苯并噻二唑、噻酰菌胺，简写为TDL、异噻菌胺，其英文通用名为：isotianil、4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-甲酸、4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-甲酸钠、4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-甲酸乙酯、3,4-二氯异噻唑-5-甲酸、3,4-二氯异噻唑-5-甲酸钠、3,4-二氯异噻唑-5-甲酸乙酯、DL-β-氨基丁酸、病毒唑、安托芬、宁南霉素、噻酰胺、甲噻诱胺或水杨酸、嘧肽霉素、二氯异烟酸、烯丙异噻唑、井冈羟胺、井冈霉素；本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ在所述抗病毒组合物中的总的质量百分含量是1%-90%，本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与前述商品抗植物病毒剂的比例为质量百分比1%:99%到99%:1%；所述抗病毒组合物加工的剂型选自：种子处理乳剂、水乳剂、微乳剂、悬乳剂、胶囊悬浮剂、水溶性粒剂、细粒剂、可溶性浓剂、毒谷、块状毒饵、粒状毒饵、片状毒饵、浓毒饵、缓释块、静电喷雾剂、水包油乳剂、烟雾罐、烟雾烛、烟雾筒、烟雾棒、烟雾片、烟雾丸、发气剂、油膏、热雾剂、冷雾剂、气雾剂、固/液混合装剂、液/液混合装剂、固/固混合装剂、药漆、微粒剂、追踪粉剂、油悬剂、油分散性粉剂、浓胶剂、泼浇剂、种衣剂、涂抹剂、成膜油剂、超低容量液剂、蒸汽释放剂；所述抗病毒组合物防治的病毒病害选自：水稻矮缩病、黄矮病、条纹叶枯病、番茄蕨叶病毒病、辣椒花叶病毒病、烟草脉坏死病毒病、玉米矮花叶病、花椰菜花叶病毒、柑橘病毒病、建兰花叶病毒、建兰环斑病毒；所述抗病毒组合物用于防治的植物选自：稻谷、小麦、大麦、燕麦、玉米、高粱、甘薯、马铃薯、木薯、大豆、荷兰豆、蚕豆、豌豆、绿豆、小豆、棉花、蚕桑、花生、油菜、芝麻、向日葵、甜菜、甘蔗、咖啡、可可、人参、贝母、橡胶、椰子、油棕、剑麻、烟草、番茄、辣椒、萝卜、黄瓜、白菜、芹菜、榨菜、甜菜、油菜、葱、大蒜、西瓜、甜瓜、哈密瓜、木瓜、苹果、柑桔和桃树、茶、山野菜、竹笋、啤酒花、胡椒、香蕉、番木瓜、兰花、盆景。

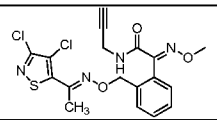
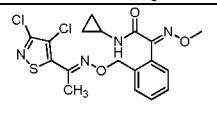
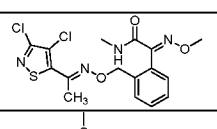
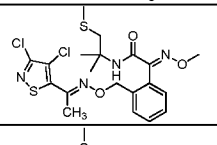
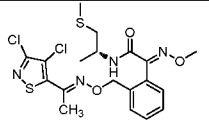
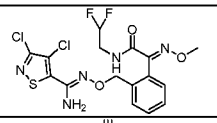
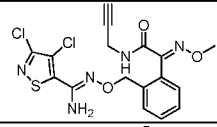
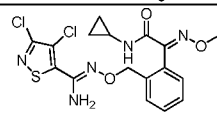
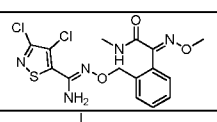
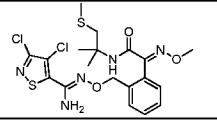
实施例 14：本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与杀螨剂组合在防治农业和林业以及园艺植物螨害中的应用：

本发明的所有异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与商品杀螨剂中的任意一种或两种组合形成杀螨组合物用于防治农业和林业以及园艺植物螨害，所述商品杀螨剂选自：三唑锡、三环锡、苯丁锡、三磷锡、毒虫畏、甲基毒虫畏、巴毒磷、敌敌畏、庚烯磷、速灭磷、久效磷、二溴磷、毒死蜱、嘧啶磷、氯甲亚胺硫磷、氧乐果、敌杀磷、乙硫磷、马拉硫磷、虫螨畏、伏杀硫磷、辛硫磷、甲基嘧啶硫磷、喹硫磷、治螟磷、三唑磷、蚜灭多、水胺硫磷、甲胺磷、胺丙畏、氯亚胺硫磷、亚胺硫磷、氟丙菊酯、联苯菊酯、氯氟氰菊酯、精高效氯氟氰菊酯、甲氰菊酯、氟氰戊菊酯、氟氯苯菊酯、氟胺氰菊酯、溴氟菊酯、联苯肼酯、苯硫威、涕灭威、丁酮威、杀线威、抗虫威、久效威、苯菌灵、氯灭杀威、克百威、丁硫克百威、速灭威、蜱虱威、伐虫脒、单甲脒、杀螨脒、双甲脒、杀虫脒、苯甲酸苄酯、溴螨酯、丁氟螨酯、灭螨醌、氟蚜螨、氟虫脲、浏阳霉素、虫螨霉素、苏云金素、杀螨素、浏阳霉素、阿维菌素、多拉菌素、埃普利诺菌素、伊维菌素、赛拉菌素、莫西菌素、除虫菊素、烟碱、苦参碱、印楝素、鱼藤酮、吡螨胺、哒螨酮、唑螨酯、四螨嗪、炔螨特、噻

螨酮、螺螨酯、嘧螨酯、杀螨酯、克螨特、哒螨灵；本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ在所述杀螨组合物中的总的质量百分含量是1%-90%，本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与所述商品杀螨剂的比例为质量百分比1%:99%到99%:1%；所述杀螨组合物加工的剂型选自：种子处理乳剂、水乳剂、微乳剂、悬乳剂、胶囊悬浮剂、水溶性粒剂、细粒剂、可溶性浓剂、毒谷、块状毒饵、粒状毒饵、片状毒饵、浓毒饵、缓释块、静电喷雾剂、水包油乳剂、烟雾罐、烟雾烛、烟雾筒、烟雾棒、烟雾片、烟雾丸、发气剂、油膏、热雾剂、冷雾剂、气雾剂、固/液混合装剂、液/液混合装剂、固/固混合装剂、药漆、微粒剂、追踪粉剂、油悬剂、油分散性粉剂、浓胶剂、泼浇剂、种衣剂、涂抹剂、成膜油剂、超低容量液剂、蒸汽释放剂；所述杀螨组合物防治的螨害选自：螨害选自叶螨科、细须螨科、吠线螨、瘿螨科、红叶螨属、瘿螨科的害螨，这些害螨是世界性农业害螨、林业害螨、园艺害螨和卫生害螨；所述杀螨组合物用于防治的植物选自：稻谷、小麦、大麦、燕麦、玉米、高粱、甘薯、马铃薯、木薯、大豆、荷兰豆、蚕豆、豌豆、绿豆、小豆、棉花、蚕桑、花生、油菜、芝麻、向日葵、甜菜、甘蔗、咖啡、可可、人参、贝母、橡胶、椰子、油棕、剑麻、烟草、番茄、辣椒、萝卜、黄瓜、白菜、芹菜、榨菜、甜菜、油菜、葱、大蒜、西瓜、甜瓜、哈密瓜、木瓜、苹果、柑桔和桃树、茶、山野菜、竹笋、啤酒花、胡椒、香蕉、番木瓜、兰花、盆景。

表 1 本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ的化学结构和理化参数

序号	编号	化学结构	熔点 °C	^{1}HNMR($CDCl_3$,400MHz,ppm)	收率%	外观
1	CL03-49		100-102	δ7.53(s,1H,C=CH),7.42-7.36(m,1H,Ph-H),7.31-7.23(m,2H,Ph-H),7.13-7.07(m,1H,Ph-H),5.20(s,2H,Ph-CH_2),3.72(s,O-CH_3),3.59(s,O-CH_3),2.45(s,C-CH_3)	59.14%	黄色晶体
2	CL03-50		61-63	δ8.10(s,1H,O=C-H),7.54(s,1H,C=CH),7.39(dd,*J*=5.4,3.6Hz,1H,Ph-H),7.28(dd,*J*=5.7,3.4Hz,2H,Ph-H),7.11(dd,*J*=5.4,3.5Hz,1H,Ph-H),5.08(s,2H,Ph-CH_2),3.77(s,3H,O-CH_3),3.63(s,3H,O-CH_3)	56.82%	黄色晶体
3	CL04-03		105-107	δ7.61(s,1H,C=CH-O),7.48(dd,*J*=8.3,4.9Hz,1H,Ph-H),7.37(dd,*J*=5.3,3.8Hz,2H,Ph-H),7.22-7.18(m,1H,Ph-H),5.29(s,2H,NH_2),5.02(s,2H,Ph-CH_2),3.84(s, 3H, O-CH_3),3.73(s,3H, O-CH_3)	97.83%	黄色固体
4	CL04-04 上		36-38	δ7.51(s,1H,C=CH-O),7.33(dd,*J*=5.9,3.1Hz,1H,Ph-H),7.29-7.24(m,2H,Ph-H),7.12-7.06(m,1H,Ph-H),5.22(ddd,*J*=9.0,3.7,2.7Hz,O-CH),4.94(s,2H,Ph-CH_2),3.78-3.73(s,3H,O-CH_3),3.62(s,3H,O-CH_3),2.73(dd,*J*=16.9,2.4Hz,1H,N=C-CH_2),2.42(dd,*J*=16.8,9.1Hz,1H,N=C-CH_2),1.81(s,3H,N=C-CH_3)	92.11%	淡黄色固体
5	CL04-04 下		103-105	δ11.74(s,1H,O=C-CH_2),7.53(s,1H,C=CH-O),7.36(m,1H,Ph-H),7.337.23(m,2H,Ph-H),7.11(m,2H,Ph-H),5.92(s,1H,O=C-CH_2),4.98(s,2H,Ph-CH_2),3.77(s,3H,O-CH_3),3.63(s,3H,O-CH_3),2.00(s,3H,N=C-CH_3)	47.62%	黄色固体
6	CL04-06		101-103	δ7.57(s,1H,C=CH-O),7.45(dd,*J*=7.3,4.5Hz,2H,CH=CH,Ph-H),7.35-7.31(m,2H,Ph-H),7.19-7.15(m,1H,Ph-H),6.88(d,*J*=16.7Hz,1H,CH=CH),5.09(s,2H,Ph-CH_2),3.81(s,3H,O-CH_3),3.67(s,3H,O-CH_3),2.11(s,3H,N=C-CH_3)	40.00%	白色固体
7	CL04-15A		73-75	δ7.51(s,1H,Ph-H),7.47-7.43(m,2H,Ph-H),7.24-7.20(m,1H,Ph-H),5.23(s,2H,Ph-CH_2),4.06(s,3H,O-CH_3),3.83(s,3H,O-CH_3),2.52(s,3H,N=C-CH_3)	71.43%	淡黄色粉末
8	CL04-15B		88-90	δ7.74(s,1H,N=C-H),7.42(s,1H,Ph-H),7.37(dd,*J*=6.9,2.9Hz,2H,Ph-H),7.15-7.12(m,1H,Ph-H),5.22(s,2H,Ph-CH_2),3.96(s,3H,O-CH_3),3.72(s,3H,O-CH_3)	72.73%	淡黄色粉末
9	CL04-15C		104-106	δ7.40-7.30(m,3H,Ph-H),7.13(d,*J*=6.4Hz,1H,Ph-H),5.18(s,2H,NH_2),4.91(s,2H,Ph-CH_2),3.97(s,3H,O-CH_3),3.79(s,3H,O-CH_3)	42.96%	棕黄色晶体
10	CL04-22A		78-80	δ7.57-7.39(m,3H,Ph-H),7.22(dd,*J*=6.7,1.9Hz,1H,Ph-H),7.11(s,1H,Ph-H),5.91(tdd,*J*=55.9,8.6,4.3Hz,1H,CHF_2),5.18(d,*J*=38.8Hz,2H,Ph-CH_2),4.00(d,*J*=13.8Hz,3H,O-CH_3),3.83-3.65(m,2H,N-CH_2),2.42(d,*J*=72.2Hz,3H,N=C-CH_3)	95.00%	白色晶体

11	CL04-22B		120-122	δ7.50(s,1H,Ph-H),7.44(dd,*J*=9.6,5.3Hz,2H,Ph-H),7.22(d,*J*=6.8Hz,1H,Ph-H),6.99(s,1H,O=C-NH),5.24(s,2H,Ph-CH_2),4.14(d,*J*=5.2Hz,2H,N-CH_2),3.98(s,3H,O-CH_3),2.42(d,*J*=70.7Hz,3H,N=C-CH_3),2.29(d,*J*=9.0Hz,1H,C≡CH)	95%	白色晶体
12	CL04-22C		115-117	δ7.50(d,*J*=7.0Hz,1H,Ph-H),7.42(dt,*J*=11.5,8.0Hz,2H,Ph-H),7.22(d,*J*=6.7Hz,1H,Ph-H),6.87(s,1H,O=C-NH),5.24(s,2H,,Ph-CH_2),3.93(s,3H,O-CH_3),2.78(d,*J*=3.6Hz,1H,N-CH),2.51(s,3H,N=C-CH_3),0.82(d,*J*=6.3Hz,2H,cyclopropyl-CH_2),0.59(s,2H,cyclopropyl-CH_2)	72.73%	透明晶体
13	CL04-22D		79-81	δ7.52-7.44(m,1H,Ph-H),7.40(dd,*J*=9.4,5.8Hz,2H,Ph-H),7.21(d,*J*=7.2Hz,1H,Ph-H),6.92(d,*J*=4.5Hz,1H,O=C-NH),5.25(s,2H,Ph-CH_2),3.91(s,3H,O-CH_3),2.84(d,*J*=4.9Hz,3H,N-CH_3),2.48(s,3H,N=C-CH_3)	70.97%	白色固体
14	CL04-22E		-	δ7.47(d,*J*=6.8Hz,1H,Ph-H),7.44-7.38(m,2H,Ph-H),7.23-7.19(m,1H,Ph-H),6.93(s,1H,O=C-NH),5.15(s,2H,Ph-CH_2),3.99(s,3H,O-CH_3),3.00(s,2H,S-CH_2),2.37(s,3H,N=C-CH_3),2.19(s,3H,S-CH_3),1.49(s,6H,CH_3-C-CH_3)	36.84%	黄色油状
15	CL04-22F		35-37	δ7.44(dd,*J*=7.2,4.1Hz,1H,Ph-H),7.42-7.37(m,2H,Ph-H),7.20(d,*J*=6.7Hz,1H,Ph-H),6.88(d,*J*=8.0Hz,1H,O=C-NH),5.13(s,2H,Ph-CH_2),4.24(dt,*J*=13.4,6.6Hz,1H,N-CH),3.98(s,3H,O-CH_3),2.72(dd,*J*=13.5,5.5Hz,1H,S-CH_2),2.63(dd,*J*=13.5,6.4Hz,1H,S-CH_2),2.33(s,3H,N=C-CH_3),2.15(s,3H,S-CH_3),1.32(d,*J*=6.6Hz,3H,N-C-CH_3)	37.84%	白色粉状固体
16	CL04-24		118-120	δ7.37(s,1H,Ph-H),7.35-7.30(m,2H,Ph-H),7.13-7.08(m,1H,Ph-H),7.02(s,1H,O=C-NH),5.84(tt,*J*=55.9,4.0Hz,1H,CHF_2),5.18(s,2H,NH_2),4.88(s,2H,Ph-CH_2),3.92(s,3H,O-CH_3),3.73-3.60(m,2H,N-CH_2)	76.60%	透明晶体
17	CL04-25A		106-108	δ7.36(t,*J*=3.6Hz,1H,Ph-H),7.35–7.31(m,2H,Ph-H),7.10(dd,*J*=5.8,3.0Hz,1H,Ph-H),6.92(s,1H,O=C-NH),5.21(s,2H,NH_2),4.88(s,2H,Ph-CH_2),4.08(dd,*J*=5.4,2.5Hz,2H,N-CH_3),3.91(s,3H,O-CH_3),2.17(t,*J*=2.5Hz,1H,C≡CH)	71.43%	白色固体
18	CL04-25B		12-128	δ7.38–7.35(m,1H,Ph-H),7.34–7.30(m,2H,Ph-H),7.11-7.08(m,1H,Ph-H),6.80(s,1H,O=C-NH),5.27(s,2H,NH_2),4.87(s,2H,Ph-CH_2),3.87(s,3H,O-CH_3),2.77-2.70(m,1H,N-CH),0.73(dd,*J*=7.0,5.4Hz,2H,cyclopropyl-CH_2),0.55-0.50(m,2H,cyclopropyl-CH_2)	48.71%	白色粉末
19	CL04-25C		122-124	δ7.37(d,*J*=5.7Hz,1H,Ph-H),7.32(dd,*J*=6.0,3.1Hz,2H,Ph-H),7.12-7.08(m,1H,Ph-H),6.73(d,*J*=3.8Hz,1H,O=C-NH),5.25(s,2H,NH_2),4.88(s,2H,Ph-CH_2),3.88(s,3H,O-CH_3),2.84(d,*J*=5.0Hz,3H,N-CH_3)	39.39%	白色粉末
20	CL04-25D		28-30	δ7.44(dd,*J*=5.9,3.3Hz,1H,Ph-H),7.40-7.36(m,2H,Ph-H),7.16(dd,*J*=5.6,3.3Hz,1H,Ph-H),6.91(s,1H,O=C-NH),5.35(s,2H,NH_2),4.96(s,2H,Ph-CH_2),3.96(s,3H,O-CH_3),2.98(s,2H,S-CH_2),2.16(s,3H,S-CH_3),1.46(s,6H,CH_3-C-CH_3)	58.06%	黄色透明晶体

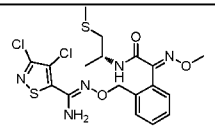
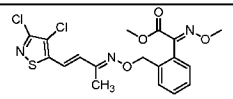
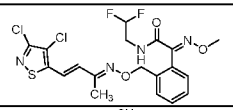
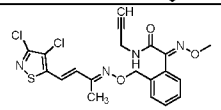
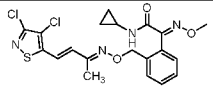
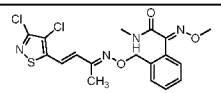
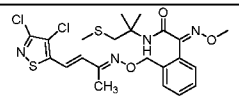
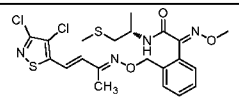
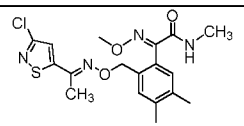
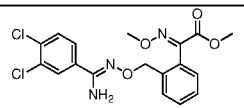
21	CL04-25E		-	δ7.44(dd,*J*=3.9,1.9Hz,1H,Ph-H),7.41-7.38(m,2H,Ph-H),7.20-7.16(m,1H,Ph-H),6.91(d,*J*=8.2Hz,1H,O=C-NH),5.34(s,2H,NH_2),4.96(s,2H,Ph-CH_2),4.29-4.21(m,1H,N-CH),3.97(s,3H,O-CH_3),2.73(dd,*J*=13.5,5.5Hz,1H,S-CH_2),2.64(dd,*J*=13.5,6.4Hz,1H,S-CH_2),2.15(s,3H,S-CH_3),1.32(d,*J*=6.6Hz,3H,N-C-CH_3)	44.19%	黄色油状
22	CL04-17		105-107	δ7.35(ddd, *J*=9.6, 6.1, 2.0Hz, 3H, Ph-H), 7.14-7.11(m, 1H, Ph-H), 6.75(d, *J*=5.1Hz, 2H, CH=CH), 5.02(s, 2H, Ph-CH_2), 3.97(s, 3H, O-CH_3), 3.79(s, 3H, N-CH_3), 1.97(s, 3H, C=C-CH_3)	60.00%	白色粉末
23	CL04-32A		98-100	δ7.47-7.36(m,4H,CH=CH,Ph-H),7.21-7.16(m,1H,Ph-H),7.07(d,*J*=5.8Hz,1H,O=C-NH),6.87(d,*J*=16.7Hz,1H,CH=CH),5.86(tt,*J*=55.9,4.1Hz,1H,CHF_2),5.05(s,2H,Ph-CH_2),3.97(s,3H,O-CH_3),3.80-3.63(m,2H,N-CH_2),2.09(s,3H,N=C-CH_3)	53.57%	白色固体
24	CL04-32B		92-93	δ7.47-7.35(m,4H,CH=CH,Ph-H),7.21-7.17(m,1H,Ph-H),7.00–6.91(m,1H,O=C-NH),6.82(d,*J*=3.7Hz,1H,CH=CH),5.05(s,2H,Ph-CH_2),4.17(s,1H,N-CH_2),4.12–4.09(m,1H,N-CH_2),3.97(s,3H,O-CH_3),2.26(dt,*J*=6.8,2.6Hz,1H,C≡CH),2.05(s,3H,N=C-CH_3)	62.96%	白色固体
25	CL04-32C		95-97	δ7.50-7.36(m,4H,CH=CH,Ph-H),7.22(d,*J*=6.9Hz,1H,Ph-H),6.86(t,*J*=6.0Hz,2H,O=C-NH,CH=CH),5.11(s,2H,Ph-CH_2),3.97(s,3H,O-CH_3),2.07(s,3H,N=C-CH_3),0.84(d,*J*=5.6Hz,2H,cyclopropyl-CH_2),0.62(dd,*J*=3.7,1.7Hz,2H,cyclopropyl-CH_2)	59.26%	白色粉末
26	CL04-32D		137-139	δ7.48-7.35(m,4H,CH=CH,Ph-H),7.21-7.16(m,1H,Ph-H),6.81(d,*J*=3.7Hz,1H,CH=CH),6.77(s,1H,O=C-NH),5.09(s,2H,Ph-CH_2),3.96(s,3H,O-CH_3),2.93(d,*J*=5.0Hz,3H,N-CH_3),2.04(s,3H,N=C-CH_3)	65.38%	透明晶体
27	CL04-32E		-	δ7.47-7.34(m,4H,CH=CH,Ph-H),7.18(d,*J*=7.3Hz,1H,Ph-H),6.89(d,*J*=2.9Hz,1H,O=C-NH),6.83(s,1H,CH=CH),5.09(d,*J*=17.2Hz,2H,Ph-CH_2),3.97(s,3H,O-CH_3),2.98(s,2H,S-CH_2),2.16(s,3H,S-CH_3),2.07(s,3H,N=C-CH_3),1.47(s,6H,CH_3-C-CH_3)	100%	黄色油状
28	CL04-32F		-	δ7.41-7.26(m,4H,CH=CH,Ph-H),7.12(dd,*J*=6.7,2.0Hz,1H,Ph-H),6.81(d,*J*=4.5Hz,1H,O=C-NH),6.74(s,1H,CH=CH),5.03(s,2H,Ph-CH_2),4.16(dd,*J*=13.3,6.6Hz,1H,N-CH),3.89(s,3H,O-CH_3),2.68-2.47(m,2H,S-CH_2),2.07(s,3H,S-CH_3),1.98(s,3H,N=C-CH_3),1.24(d,*J*=6.7Hz,3H,N-C-CH_3)	84.62%	黄色油状
29	CL04-00		-	-	68.22%	-
30	CL05-00		111-113	δ 7.70 (s, 1H, Ph-H), 7.51 – 7.36 (m, 5H, Ph-H), 7.20 (d, *J* = 7.2 Hz, 1H ,Ph-H), 5.01 (s, 2H, Ph-CH_2), 4.74 (s, 2H,-NH_2), 4.04 (s, 3H,O-CH_3), 3.84 (s, 3H,N-CH_3).	55.57%	白色晶体

表 2 本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ的抑菌活性(50 微克/毫升的抑制率/%)

序号	化合物	AS	CA	GZ	PP	BC	SS	RC	PS	PI
1	CL03-49	42.86	66.67	52.17	78.26	100	80.00	100	64.71	52.63
2	CL03-50	57.14	66.67	73.91	78.26	100	53.33	100	64.71	57.89
3	CL04-03	57.14	100	60.87	86.96	100	100	100	58.82	47.37
4	CL04-04 上	85.71	75.00	60.87	73.91	100	90.00	100	52.94	42.11
5	CL04-04 下	50.00	75.00	73.91	60.87	58.33	76.67	92.59	64.71	52.63
6	CL04-06	57.14	50.00	73.91	73.91	100	100	100	70.59	78.95
7	CL04-15A	47.06	50.00	41.18	53.03	100	100	85.45	76.92	78.95
8	CL04-15B	100	91.67	70.59	62.12	100	90.00	98.18	69.23	94.74
9	CL04-15C	52.94	75.00	94.44	71.21	100	98.00	89.09	76.92	89.47
10	CL04-22A	37.14	42.86	78.95	40.35	53.85	84.00	87.70	20.00	80.00
11	CL04-22B	28.57	35.71	100	49.12	51.92	100	86.89	73.33	80.00
12	CL04-22C	27.87	44.00	63.64	61.40	47.37	80.00	60.98	56.76	100
13	CL04-22D	47.54	87.50	100	80.77	100	100	100	89.19	100
14	CL04-22E	27.27	45.83	51.52	42.86	62.50	29.41	76.00	21.21	28.57
15	CL04-22F	16.36	12.50	33.33	32.77	45.54	52.94	76.00	15.15	17.14
16	CL04-24	12.73	16.67	33.33	39.50	37.50	52.94	62.00	24.24	22.86
17	CL04-25A	8.20	20.00	54.55	19.30	42.11	46.67	65.85	45.95	100
18	CL04-25B	21.31	28.00	63.64	22.81	36.84	73.33	85.37	18.92	33.33
19	CL04-25C	34.43	44.00	100	40.35	57.89	66.67	100	83.78	100
20	CL04-25D	16.36	12.50	21.21	27.73	39.29	52.94	62.00	15.15	17.14
21	CL04-25E	9.09	16.67	45.45	10.92	35.71	52.94	54.00	21.21	11.43
22	CL04-17	35.71	50.00	60.87	47.83	100	86.67	81.48	58.82	47.37
23	CL04-32A	34.43	36.00	45.45	29.82	52.63	53.33	85.37	35.14	90.48
24	CL04-32B	40.98	52.00	81.82	64.91	47.37	80.00	100	78.38	100
25	CL04-32C	47.54	60.00	63.64	71.93	57.89	73.33	70.73	67.57	100
26	CL04-32D	54.10	84.00	100	64.91	84.21	73.33	85.37	89.19	100
27	CL04-32E	5.45	12.50	24.24	39.50	32.14	41.18	58.00	15.15	11.43
28	CL04-32F	12.73	12.50	60.61	57.98	42.86	52.94	62.00	21.21	20.00
29	CL04-00	21.54	22.60	29.63	36.97	32.44	22.64	12.03	21.28	32.02
30	CL05-00	44.44	65.00	50.00	61.21	75.00	66.67	85.71	53.91	76.36
31	嘧菌酯	75.00	55.56	71.43	100	91.18	88.10	84.06	80.77	46.88
32	烯肟菌酯	50.00	55.22	21.54	59.09	48.57	44.00	73.97	57.50	32.97

表 3 本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ防治黄瓜白粉病的活性

药剂处理	用药量		基数病指	药后指数	平均防效(%)	差异显著性	
	有效成份 (g/hm^2)	商品量 (克/亩)				5%	1%
9.60% CL04-22D 乳油	37.5	26.04	1.98	8.01	78.62	a	A
250g/L 嘧菌酯 SC	37.5	5	1.66	9.59	70.19	b	B
50%肟菌酯(FLINT)WG	37.5	10	1.64	10.04	68.02	b	B
空白对照	-	-	1.07	20.63	-	-	-

表 4 本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ防治黄瓜霜霉病的活性

药剂处理	用药量		基数病指	药后指数	平均防效(%)	差异显著性 5%
	有效成份(g/hm^2)	商品量(克/亩)				
9.60% CL04-22D 乳油	75	56.82	3.71	5.39	79.18	a
50% 肟菌酯 WG	75	10	3.73	7.24	72.02	b
250g/L 吡唑醚菌酯 EC	75	20	3.57	5.78	77.52	a
空白对照	-	-	3.58	24.96	-	-

表 5 本发明的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ的抗烟草花叶病毒的活性(100 微克/毫升的抑制率/%)

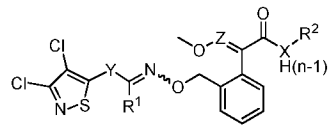
序号	化合物	治疗模式	钝化模式	保护模式	诱导模式
1	CL03-49	39.41±2.99	52.48±0.64	35.90±0.63	75.90±0.83
2	CL03-50	48.32±5.88	70.19±0.41	54.02±0.51	84.02±5.51
3	CL04-03	45.04±4.15	81.75±2.83	35.13±0.39	75.13±0.69
4	CL04-04 上	19.10±2.13	75.46±7.91	61.60±1.25	71.60±1.55
5	CL04-04 下	19.10±2.00	65.46±7.46	45.46±3.70	55.46±6.70
6	CL04-06	22.43±6.85	22.22±5.90	54.08±3.81	74.08±5.81
7	CL04-15A	1.52±0.62	54.76±1.26	40.53±0.84	70.53±0.84
8	CL04-15B	27.00±4.13	52.13±6.48	14.74±2.73	74.74±2.73
9	CL04-15C	1.52±0.62	59.94±2.76	25.08±4.33	85.08±5.33
10	CL04-22A	23.44±5.58	49.90±3.63	30.71±2.06	60.71±2.26
11	CL04-22B	1.52±0.62	36.70±4.98	53.10±0.75	53.10±0.75
12	CL04-22C	4.62±0.55	4.44±0.85	23.57±0.57	83.57±0.07
13	CL04-22D	32.78±3.36	4.44±0.85	49.05±2.77	79.05±7.77
14	CL04-22E	20.25±5.58	45.40±2.20	22.71±2.05	12.71±6.05
15	CL04-22F	1.52±0.62	0	23.76±3.42	63.76±3.52
16	CL04-24	14.96±3.08	27.30±6.56	36.78±5.50	46.78±7.70
17	CL04-25A	82.36±5.02	0	40.74±2.51	70.74±2.81
18	CL04-25B	20.51±1.84	0	19.56±3.36	18.56±3.76
19	CL04-25C	14.68±4.84	0	59.82±4.23	69.82±5.27
20	CL04-25D	35.93±1.63	0	21.15±1.69	21.15±3.69
21	CL04-25E	19.12±6.56	0	26.00±4.71	16.00±7.71
22	CL04-17	31.56±3.95	35.93±1.53	29.27±1.31	39.27±1.41
23	CL04-32A	1.52±0.62	37.75±6.62	45.32±2.00	45.32±2.00
24	CL04-32B	81.33±5.49	72.13±5.59	23.43±1.02	73.43±4.09
25	CL04-32C	31.56±3.91	41.40±0.92	19.00±0.72	16.00±7.71
26	CL04-32D	1.52±0.62	69.27±1.02	39.07±2.73	39.07±2.73
27	CL04-32E	1.52±0.62	13.65±0.55	40.79±0.77	70.79±3.77
28	CL04-32F	63.67±5.66	7.71±1.42	53.40±4.73	63.40±6.73
29	CL04-00	27.32±1.24	20.68±2.10	26.30±2.47	20.34±2.16
30	CL05-00	26.39±1.22	19.68±1.10	25.30±1.47	19.34±1.14
31	宁南霉素	74.10±2.04	-	-	-
32	TDL	-	-	-	65.00±2.00
33	BTH	-	-	78.10±0.54	78.00±1.34
34	SZG-7	-	-	-	79.00±2.27
35	病毒唑	-	78.00±1.00	-	-
36	异噻菌胺	27.31±2.12	20.77±7.30	24.80±5.85	44.44±5.18

工业实用性

本发明提供了一类异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物及其制备方法和用途。本发明提供给的化合物能够调控农业、园艺、卫生和林业植物害虫、植物病原物的生物活性，可用于农业领域、园艺领域、林业领域杀虫、杀螨、杀菌、抗植物病毒、诱导植物产生抗病性，具有较好的经济价值和应用前景。

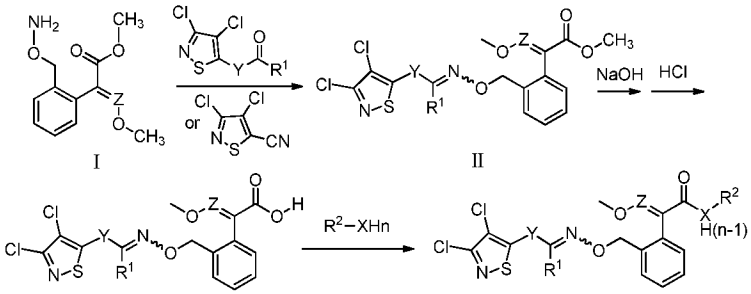
权 利 要 求 书

1. 一类异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物，其特征在于具有如式Ⅳ所示的化学结构通式：

Ⅳ：

其中，R^1 选自：甲基、氢、胺基；R^2 选自：1,2-二氟乙基、炔丙基、环丙基、甲基、1-甲硫基-2-甲基丙-2-基、(R)-1-甲硫基丙-2-基；X 选自：氧、氮，n=1, 2；Y 选自：$CHOH-CH_2$, $CHO-CH_2$, $(CH=CH)_m$, m=0,1；Z 选自：碳、氮。

2. 权利要求 1 所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ的合成方法，具体合成路线如下：



其中，R^1 选自：甲基、氢、胺基；R^2 选自：1,2-二氟乙基、炔丙基、环丙基、甲基、1-甲硫基-2-甲基丙-2-基、(R)-1-甲硫基丙-2-基；X 选自：氧、氮，n=1, 2；Y 选自：$CHOH-CH_2$, $CHO-CH_2$, $(CH=CH)_m$, m=0,1；Z 选自：碳、氮。

3. 根据权利要求 2 所述的合成方法，其特征在于，所述的噻二唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物的合成方法分为以下步骤：

A.化合物Ⅱ的制备：

在 25 毫升单口圆底烧瓶中加入 1.10 毫摩尔将化合物 **I**、3,4-二氯异噻唑-5-取代羰基化合物和盐酸分别加入乙醇溶液中，在室温下反应，反应完全后减压除去溶剂，将残余物纯化，即得所述化合物 II；其中，所述 3,4-二氯异噻唑-5-取代羰基化合物选自：3,4-二氯异噻唑-5-甲醛、3,4-二氯异噻唑-5-乙酮、4-(3,4-二氯异噻唑-5-基)-丁-3-烯-2-酮；

或 B. 化合物Ⅱ的制备：

将化合物 **I**、3,4-二氯异噻唑-5-甲氰与巯基乙酸分别加入乙醇溶液中，在室温下反应，反应完全后将反应液浓缩，将残余物纯化，即得所述化合物 II；

C.化合物Ⅲ的制备方法：

将化合物Ⅱ与氢氧化钠加入甲醇溶液中，然后加热回流进行反应，反应完全后将反应液浓缩，残余物用乙酸乙酯稀释，然后加入水将残余物溶解，分离出水层，然后

将水层用盐酸调节 pH 至 3，然后用乙酸乙酯萃取，水层用乙酸乙酯反萃一遍，合并有机层，有机层用饱和氯化钠洗，无水硫酸钠干燥，抽滤，减压除去溶剂，即得化合物Ⅲ；

D.化合物Ⅳ的制备方法:

将化合物Ⅲ、EDCI 与 HOBT 加入至二氯甲烷中，在室温反应，然后向反应体系中加入 R^2-XH_n，n=1,2，室温下继续反应，反应完全后，反应液用水洗两遍，分离出有机层，有机层分别用饱和碳酸氢钠和饱和氯化钠洗，无水硫酸钠干燥，抽滤，减压除去溶剂，将残余物纯化，即得到所述化合物Ⅳ。

4. 权利要求 1 所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ在制备杀菌剂、抗烟草花叶病毒剂或植物激活剂中的用途。

5. 权利要求 1 所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与农业上可接受的助剂在制备杀菌剂、抗烟草花叶病毒剂或植物激活剂中的用途。

6. 权利要求 1 所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ在防治农业和林业以及园艺植物虫害中的用途。

7. 根据权利要求 6 所述的用途，其特征在于，所述异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与农业化学品共同施用；优选地，所述农业化学品选自：杀虫剂、杀菌剂、抗植物病毒剂、杀螨剂中的一种或几种。

8. 根据权利要求 6 或 7 所述的用途，其特征在于，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与所述杀虫剂中的任意一种或两种组合形成杀虫组合物用于防治农业和林业以及园艺植物虫害；

优选地，所述杀虫剂选自：毒死蜱、地亚农、啶虫脒、甲氨基阿维菌素、弥拜菌素、阿维菌素、多杀菌素、氰戊菊酯、高效氰戊菊酯、氯氰菊酯、高效氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯、溴氰菊酯、甲氰菊酯、Beta-氟氯氰菊酯、Lambda-三氟氯氰菊酯、二氯苯醚菊酯、苄氯菊酯、丙烯菊酯、联苯菊酯、氯菊酯、醚菊酯、氟氯苯菊酯、氯氟胺氰戊菊酯、吡虫啉、烯啶虫胺、氯噻啉、噻虫啉、噻虫嗪、噻虫胺、呋虫胺、可尼丁、达特南、除虫脲、灭幼脲、伏虫隆、除虫隆、氟铃脲、氟虫脲、啶虫隆、虱螨脲、毒虫脲、氟幼脲、Noviflumuron 即多氟脲，其 CAS 号为 121451-02-3、氟螨脲、Novaluron 即双苯氟脲、氟啶脲、Bay sir 6874 即 1-[(3. 5-二氯-4) 4-硝基苯氧基苯基 3-3-(2-氯苯)-脲、Bay SIR-8514 即 1-(4-三氟甲氧基苯基)-3-(2-氯苯)-脲、嗪虫脲、Bistrifluron 即双三氟虫脲、呋喃虫酰肼、虫酰肼、氯虫酰肼、甲氧虫酰肼、环虫酰肼、乐果、氧化乐果、敌敌畏、乙酰甲胺磷、三唑磷、喹硫磷、哒嗪硫磷、氯唑磷、叶

蝉散、西维因、抗蚜威、速灭威、异丙威、杀螟丹、仲丁威、叶飞散、甲萘威、丙硫克百威、丁硫克百威、杀螟丹、溴螨酯、噻螨酮、唑螨酯、哒螨酮、四螨嗪、炔螨特、丁醚脲、吡蚜酮、螺螨酯、螺虫酯、螺虫乙酯、丁烯氟虫腈、三唑锡、噻嗪酮、灭线磷、氟虫腈、杀虫单、杀虫双、氯虫酰胺、氟虫酰胺、氟氰虫酰胺、氯虫酰胺、唑虫酰胺、溴虫腈、吡嗪酮、乙螨唑、吡螨胺、哒幼酮、吡丙醚、埃玛菌素;

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ在所述杀虫组合物中的质量百分含量是1%-90%;

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与所述杀虫剂的比例为质量百分比1%:99%到99%:1%;

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

优选地，所述杀虫组合物防治的植物虫害选自：红蜘蛛、东亚飞蝗、云斑车蝗、中华稻蝗、日本黄脊蝗、单刺蝼蛄、东方蝼蛄、稻蓟马、烟蓟马、温室蓟马、稻管蓟马、麦简管蓟马、温室白粉虱、烟粉虱、黑尾叶蝉、大青叶蝉、棉叶蝉、斑衣蜡蝉、褐飞虱、白背飞虱、灰飞虱、甘蔗扁角飞虱、棉蚜、麦二叉蚜、麦长管蚜、桃蚜、高粱蚜、萝卜蚜、吹绵蚧、桑盾蚧、矢尖盾蚧、梨圆蚧、白蜡虫、红蜡蚧、朝鲜球坚蚧、梨网蝽、香蕉网蝽、细角花蝽、微小花蝽、针缘蝽、稻蛛缘蝽、稻褐蝽、稻黑蝽、稻绿蝽、绿盲蝽、苜蓿盲蝽、中黑盲蝽、大草蛉、丽草蛉、中华草蛉、谷蛾、衣蛾、黄刺蛾、褐刺蛾、扁刺蛾、麦蛾、棉红铃虫、甘薯麦蛾、小菜蛾、桃小食心虫、大豆食心虫、桃小食心虫、苹果顶梢卷叶蛾、褐带长卷叶蛾、拟小黄卷叶蛾、二化螟、豆荚螟、玉米螟、三化螟、菜螟、稻纵卷叶螟、条螟、棉卷叶野螟、桃蛀螟、黏虫、斜纹夜蛾、稻螟蛉、棉小造桥虫、甜菜夜蛾、大螟、棉铃虫、鼎点金刚钻、小地老虎、大地老虎、黄地老虎、盗毒蛾、舞毒蛾、甘薯天蛾、豆天蛾、直纹稻弄蝶、隐纹谷弄蝶、柑橘凤蝶、玉带凤蝶、菜粉蝶、苎麻赤蛱蝶、苎麻黄蛱蝶、豆芫菁、金星步甲、皱鞘步甲、麦穗步甲、沟金针虫、细胸金针虫、谷斑皮蠹、

黑皮蠹、柑橘小吉丁虫、金缘吉丁虫、黄粉虫、黑粉虫、赤拟谷盗、杂拟谷盗、铜绿异丽金龟、暗黑金龟、华北大黑鳃金龟、桑天牛、星天牛、橘褐天牛、桃红颈天牛、大猿叶虫、小猿叶虫、黄守瓜、黄曲条跳甲、绿豆象、豌豆象、蚕豆象、玉米象、米象、小麦叶蜂、梨实蜂、黄带姬蜂、黏虫白星姬蜂、螟蛉悬茧姬蜂、棉铃虫齿唇姬蜂、螟黑点疣姬蜂、蚊、蝇、虻、麦红吸浆虫、麦黄吸浆虫、稻瘿蚊、柑橘大实蝇、瓜实蝇、麦叶灰潜蝇、美洲斑潜蝇、豆秆黑潜蝇、麦秆蝇、种蝇、葱蝇、萝卜蝇、伞裙追寄蝇、玉米螟厉寄蝇、黏虫；

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

9. 根据权利要求 6 或 7 所述的用途，其特征在于，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与所述杀菌剂中的任意一种或两种组合形成杀菌组合物用于防治农业和林业以及园艺植物病害，

优选地，所述杀菌剂选自：苯并噻二唑、噻酰菌胺，简写为 TDL、噻酰胺、甲噻诱胺、4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-甲酸、4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-甲酸钠、4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-甲酸乙酯、DL-β-氨基丁酸、异噻菌胺，其英文通用名为：isotianil、3,4-二氯异噻唑-5-甲酸、3,4-二氯异噻唑-5-甲酸钠、3,4-二氯异噻唑-5-甲酸乙酯、病毒唑、安托芬、宁南霉素或水杨酸、霜脲氰、福美双、福美锌、代森锰锌、乙磷铝、甲基硫菌灵、百菌清、敌可松、腐霉利、苯锈啶、甲基托布津、托布津、精甲霜灵、氟吗啉、烯酰吗啉、高效甲霜灵、高效苯霜灵、双氯氰菌胺、磺菌胺、甲磺菌胺、噻氟菌胺、氟酰胺、叶枯酞、环丙酰菌胺、环氟菌胺、环酰菌胺、氰菌胺、硅噻菌胺、呋吡菌胺、吡噻菌胺、双炔酰菌胺、苯酰菌胺、甲呋酰胺、萎锈灵、乙菌利、异菌脲、嘧菌酯、醚菌胺、氟嘧菌酯、醚菌酯、苯氧菌胺、肟醚菌胺、啶氧菌酯、唑菌胺酯、肟菌酯、烯肟菌酯、烯肟菌胺、氧环唑、糠菌唑、环丙唑醇、苯醚甲环唑、烯唑醇、高效烯唑醇、氟环唑、腈苯唑、氟喹唑、氟硅唑、粉唑醇、己唑醇、亚胺唑、种菌唑、叶菌唑、腈菌唑、戊菌唑、丙环唑、丙硫菌唑、硅氟唑、戊唑醇、四氟醚唑、三唑醇、灭菌唑、联苯三唑醇、噻菌灵、麦穗宁、抑霉唑、高效抑霉唑、

咪鲜胺、氟菌唑、氰霜唑、咪唑菌酮、噁咪唑、稻瘟酯、噁唑菌酮、啶菌噁唑、噁霉灵、噁霜灵、噻唑菌胺、土菌灵、辛噻酮、苯噻硫氰、十二环吗啉、丁苯吗啉、十三吗啉、拌种咯、咯菌腈、氟啶胺、啶斑肟、环啶菌胺、啶酰菌胺、氟啶酰菌胺、啶菌胺、嘧菌环胺、氟嘧菌胺、嘧菌腙、嘧菌胺、嘧霉胺、氯苯嘧啶醇、氟苯嘧啶醇、灭螨猛、二氰蒽醌、乙氧喹啉、羟基喹啉、丙氧喹啉、苯氧喹啉、乙霉威、异丙菌胺、苯噻菌胺、霜霉威、磺菌威、敌瘟磷、异稻瘟净、吡菌磷、甲基立枯磷、灭瘟素、春雷霉素、多抗霉素、多氧霉素、有效霉素、井冈霉素、链霉素、甲霜灵、呋霜灵、苯霜灵、呋酰胺、灭锈胺、多菌灵、苯菌灵、甲基硫菌灵、三唑酮、乙嘧酚磺酸酯、二甲嘧酚、乙嘧酚、敌菌丹、克菌丹、灭菌丹、乙烯菌核利、氟氯菌核利、菌核净、百菌清、稻瘟灵、稻瘟净、叶枯唑、五氯硝基苯、丙森锌、三乙膦酸铝、硫磺、波尔多液、硫酸铜、氧氯化铜、氧化亚铜、氢氧化铜、苯菌酮、戊菌隆、哒菌酮、四氯苯酞、咯喹酮、螺环菌胺、三环唑、嗪胺灵、多果啶、双胍辛盐、双胍辛胺、氯硝胺、苯磺菌胺、甲苯磺菌胺、吲哚酯、敌磺钠、喹菌酮、烯丙苯噻唑、溴硝醇、碘甲烷、威百亩、敌线酯、棉隆、二氯异丙醚、噻唑磷、硫线磷、丰索磷、虫线磷、苯线磷、灭线磷、除线磷、氯唑磷、丁硫环磷、杀线威、涕灭威、克百威、硫酰氟、二氯丙烯、二氯异烟酸、烯丙异噻唑；

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ在所述杀菌组合物中的总的质量百分含量是1%-90%，

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与所述杀菌剂的比例为质量百分比1%:99%到99%:1%；

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

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

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

10. 根据权利要求 6 或 7 所述的用途，其特征在于，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与所述抗病毒药剂中的任意一种或两种组合形成抗病毒组合物用于防治农业和林业以及园艺植物病毒病害；

优选地，所述抗病毒药剂选自：苯并噻二唑、噻酰菌胺，简写为 TDL、异噻菌胺，其英文通用名为：isotianil、4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-甲酸、4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-甲酸钠、4-甲基-1,2,3-噻二唑-5-甲酸乙酯、3,4-二氯异噻唑-5-甲酸、3,4-二氯异噻唑-5-甲酸钠、3,4-二氯异噻唑-5-甲酸乙酯、DL-β-氨基丁酸、病毒唑、安托芬、宁南霉素、噻酰胺、甲噻诱胺或水杨酸、嘧肽霉素、二氯异烟酸、烯丙异噻唑、井冈羟胺、井冈霉素；

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ在所述抗病毒组合物中的总的质量百分含量是 1%-90%，

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与所述抗植物病毒剂的比例为质量百分比 1%:99%到 99%:1%；

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

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

优选地，所述抗病毒组合物用于防治的植物选自：稻谷、小麦、大麦、燕麦、

玉米、高粱、甘薯、马铃薯、木薯、大豆、荷兰豆、蚕豆、豌豆、绿豆、小豆、棉花、蚕桑、花生、油菜、芝麻、向日葵、甜菜、甘蔗、咖啡、可可、人参、贝母、橡胶、椰子、油棕、剑麻、烟草、番茄、辣椒、萝卜、黄瓜、白菜、芹菜、榨菜、甜菜、油菜、葱、大蒜、西瓜、甜瓜、哈密瓜、木瓜、苹果、柑桔和桃树、茶、山野菜、竹笋、啤酒花、胡椒、香蕉、番木瓜、兰花、盆景。

11. 根据权利要求 6 或 7 所述的用途，其特征在于，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与所述杀螨剂中的任意一种或两种组合形成杀螨组合物用于防治农业和林业以及园艺植物螨害；

优选地，所述杀螨剂选自：三唑锡、三环锡、苯丁锡、三磷锡、毒虫畏、甲基毒虫畏、巴毒磷、敌敌畏、庚烯磷、速灭磷、久效磷、二溴磷、毒死蜱、嘧啶磷、氯甲亚胺硫磷、氧乐果、敌杀磷、乙硫磷、马拉硫磷、虫螨畏、伏杀硫磷、辛硫磷、甲基嘧啶硫磷、喹硫磷、治螟磷、三唑磷、蚜灭多、水胺硫磷、甲胺磷、胺丙畏、氯亚胺硫磷、亚胺硫磷、氟丙菊酯、联苯菊酯、氯氟氰菊酯、精高效氯氟氰菊酯、甲氰菊酯、氟氰戊菊酯、氟氯苯菊酯、氟胺氰菊酯、溴氟菊酯、联苯肼酯、苯硫威、涕灭威、丁酮威、杀线威、抗虫威、久效威、苯菌灵、氯灭杀威、克百威、丁硫克百威、速灭威、蝉虱威、伐虫脒、单甲脒、杀螨脒、双甲脒、杀虫脒、苯甲酸苄酯、溴螨酯、丁氟螨酯、灭螨醌、氟蚜螨、氟虫脲、浏阳霉素、虫螨霉素、苏云金素、杀螨素、浏阳霉素、阿维菌素、多拉菌素、埃普利诺菌素、伊维菌素、赛拉菌素、莫西菌素、除虫菊素、烟碱、苦参碱、印楝素、鱼藤酮、吡螨胺、哒螨酮、唑螨酯、四螨嗪、炔螨特、噻螨酮、螺螨酯、*嘧螨酯*、杀螨酯、克螨特、哒螨灵；

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ在所述杀螨组合物中的总的质量百分含量是 1%-90%，

优选地，所述的异噻唑肟醚甲氧基丙烯酸酯衍生物Ⅳ与所述杀螨剂的比例为质量百分比 1%:99%到 99%:1%；

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

汽释放剂；

优选地，所述杀螨组合物防治的螨害选自：螨害选自叶螨科、细须螨科、吷线螨、瘿螨科、红叶螨属、瘿螨科的害螨，这些害螨是世界性农业害螨、林业害螨、园艺害螨和卫生害螨；

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/CN2017/072557

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D 275/03 (2006.01) i; A01N 43/80 (2006.01) i; A01P 1/00 (2006.01) i; A01P 3/00 (2006.01) i; A01P 7/04 (2006.01) i; A01P 7/02 (2006.01) i

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
C07D; A01N; A01P

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
VEN, CNABS, CNKI, Caplus, Registry: oxime ether, Strobilurins, fungicid, acaridid, pesticid, insecticid, imino, isothiazole, structure search

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	CN 1065658 A (IMPERICAL CHEMICAL INDUSTRIES PLC), 28 October 1992 (28.10.1992), see claims 1-10, and page 7, paragraph 2, table 1, page 34, line 13 to page 37, line 3 and page 47, graphic 1	1, 4-11
Y	CN 1065658 A (IMPERICAL CHEMICAL INDUSTRIES PLC), 28 October 1992 (28.10.1992), see claims 1-10, and page 7, paragraph 2, table 1, page 34, line 13 to page 37, line 3 and page 47, graphic 1	2-3
X	CN 1042900 A (IMPERICAL CHEMICAL INDUSTRIES PLC), 13 June 1990 (13.06.1990), see claims 1-8, page 50, line 11 to page 53, line 19, and response equations 1 and 2	1, 4-11
Y	CN 1042900 A (IMPERICAL CHEMICAL INDUSTRIES PLC), 13 June 1990 (13.06.1990), see claims 1-8, page 50, line 11 to page 53, line 19, and response equations 1 and 2	2-3
X	CN 1191670 A (SHENYANG RESEARCH INSTITUTE OF CHEMICAL INDUSTRY, MINISTRY OF CHEMICAL INDUSTRY et al.), 02 September 1998 (02.09.1998), see claims 1-10, and description, page 5, last paragraph to page 6, line 6	1, 4-11
Y	CN 1191670 A (SHENYANG RESEARCH INSTITUTE OF CHEMICAL INDUSTRY, MINISTRY OF CHEMICAL INDUSTRY et al.), 02 September 1998 (02.09.1998), see claims 1-10	2-3
X	CN 1306506 A (NOVARTIS AG), 01 August 2001 (01.08.2001), see claims 1-8, and description, page 2, line 24 to page 3, line 5	1, 4-5

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
17 April 2017 (17.04.2017)	**08 May 2017 (08.05.2017)**
Name and mailing address of the ISA/CN: State Intellectual Property Office of the P. R. China No. 6, Xitucheng Road, Jimenqiao Haidian District, Beijing 100088, China Facsimile No.: (86-10) 62019451	Authorized officer **SHA, Lei** Telephone No.: (86-10) **62084377**

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/CN2017/072557

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	CN 1306506 A (NOVARTIS AG), 01 August 2001 (01.08.2001), see claims 1-8, and description, page 2, line 24 to page 3, line 5	2-3
X	CA 2005345 A1 (HOFFMANN LA ROCHE), 29 June 1990 (29.06.1990), see claims 1-15	1, 4-5
Y	CA 2005345 A1 (HOFFMANN LA ROCHE), 29 June 1990 (29.06.1990), see claims 1-15	2-3
Y	WO 9218487 A1 (IMPERIAL CHEMICAL INDUSTRIES PLC et al.), 29 October 1992 (29.10.1992), see claims 1 and 13	2-3
Y	WO 2008104101 A1 (SHENYANG RESEARCH INSTITUTE OF CHEMICAL INDUSTRY et al.), 04 September 2008 (04.09.2008), see synthesis embodiments	2-3

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.
PCT/CN2017/072557

Patent Documents referred in the Report	Publication Date	Patent Family	Publication Date
CN 1065658 A	28 October 1992	EP 0569384 A1	18 November 1993
		GB 9200635 D0	11 March 1992
		US 5342837 A	30 August 1994
		IE 920144 A1	29 July 1992
		MA 22400 A1	01 October 1992
		DE 69211983 T2	21 November 1996
		DK 0569384 T4	04 December 2000
		AP 9200348 D0	31 January 1992
		AT 139993 T	15 July 1996
		DE 69211983 T3	28 December 2000
		PT 100072 A	31 March 1993
		DK 0569384 T3	18 November 1996
		WO 9213830 A1	20 August 1992
		EP 0569384 B1	03 July 1996
		ES 2088572 T5	01 January 2001
		EP 0569384 B2	04 October 2000
		JP H06504538 A	26 May 1994
		ES 2088572 T3	16 August 1996
		US 5221691 A	22 June 1993
		AU 1161992 A	07 September 1992
		IL 100671 D0	06 September 1992
		DE 69211983 D1	08 August 1996
CN 1042900 A	01 June 1990	HU T52030 A	28 June 1990
		LV 10082 A	10 May 1994
		AR 247741 A1	31 March 1995
		DE 68905765 D1	06 May 1993
		GR 3007535 T3	31 August 1993
		EP 0506149 A2	30 September 1992
		IE 893508 L	21 May 1990
		DE 68928783 D1	17 September 1998
		ES 2054025 T5	16 February 1998
		KR 0133666 B1	21 April 1998
		EP 0370629 A1	30 May 1990
		JP H02188565 A	24 July 1990
		US 5432197 A	11 July 1995
		DK 584789 D0	21 November 1989
		CN 1024005 C	16 March 1994
		EP 0506149 A3	01 December 1993
		DK 584789 A	22 May 1990
		AU 627239 B2	20 August 1992
		IE 64709 B1	23 August 1995
		ES 2118769 T3	01 October 1998
		PT 92359 A	31 May 1990
		RU 2024496 C1	15 December 1994
		AP 8900147 D0	31 January 1990
		US 5763640 A	09 June 1998
		ID 1026 B	21 October 1996
		PT 92359 B	31 July 1998
		AU 4430889 A	17 May 1990
		US 5371084 A	06 December 1994

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.
PCT/CN2017/072557

Patent Documents referred in the Report	Publication Date	Patent Family	Publication Date
		NZ 231242 A	28 May 1991
		IL 92200 A	25 January 1994
		EP 0370629 B2	07 January 1998
		PL 160277 B1	26 February 1993
		DE 68905765 T3	26 March 1998
		DK 174963 B1	05 April 2004
		AT 169616 T	15 August 1998
		EP 0370629 B1	31 March 1993
		EP 0506149 B1	12 August 1998
		DE 68905765 T2	08 July 1993
		CA 2003480 A1	21 May 1990
		CZ 282034 B6	16 April 1997
		US 5055471 A	08 October 1991
		DE 68928783 T2	24 December 1998
		PL 162219 B1	30 September 1993
		CZ 8906590 A3	15 January 1997
		GB 8924122 D0	13 December 1989
		HU 204491 B	28 January 1992
		GR 3025912 T3	30 April 1998
		SK 279372 B6	07 October 1998
		AP 127 A	20 March 1991
CN 1191670 A	02 September 1998	CN 1062711 C	07 March 2001
		US 6177462 B1	23 January 2001
CN 1306506 A	01 August 2001	ZA 200006595 B	29 November 2001
		EP 1095013 A1	02 May 2001
		CA 2332886 A1	27 January 2000
		ZA 200006595 A	29 November 2001
		PL 344999 A1	19 November 2001
		AT 243190 T	15 July 2003
		HU 0102678 A3	28 March 2002
		BR 9912089 A	10 April 2001
		AU 5037899 A	07 February 2000
		HU 0102678 A2	28 November 2001
		AR 020603 A1	22 May 2002
		JP 2002520383 A	09 July 2002
		DE 69908946 T2	01 July 2004
		GT 199900106 A	30 December 2000
		US 2001018452 A1	30 August 2001
		TR 200003715 T2	23 July 2001
		EP 1095013 B1	18 June 2003
		IL 139373 D0	25 November 2001
		WO 0003974 A1	27 January 2000
		TW 476745 B	21 February 2002
		DE 69908946 D1	24 July 2003
CA 2005345 A1	29 June 1990	DK 206290 D0	28 August 1990
		AT 117983 T	15 February 1995
		EP 0403618 B2	28 April 2004
		PT 92753 A	29 June 1990
		EP 0403618 B1	01 February 1995
		PT 92753 B	29 December 1995

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.
PCT/CN2017/072557

Patent Documents referred in the Report	Publication Date	Patent Family	Publication Date
		JP H03503056 A	11 July 1991
		FI 904230 A0	27 August 1990
		BR 8907287 A	12 March 1991
		DE 58908972 D1	16 March 1995
		HU 216144 B	28 April 1999
		NO 903771 A	28 August 1990
		KR 100187541 B1	01 June 1999
		AU 4639089 A	01 August 1990
		WO 9007493 A1	12 July 1990
		ES 2067570 T3	01 April 1995
		MX 9202638 A	30 June 1992
		HU T55951 A	29 July 1991
		EP 0403618 A1	27 December 1990
		DK 206290 A	28 August 1990
		NZ 231891 A	26 August 1992
		NO 173543 C	29 December 1993
		HU 900284 D0	28 May 1991
		NO 173543 B	20 September 1993
		NO 903771 D0	28 August 1990
		JP 2907540 B2	21 June 1999
WO 9218487 A1	29 October 1992	HU 213320 B	28 May 1997
		BR 9205902 A	08 November 1994
		AU 1538092 A	17 November 1992
		JP 3112479 B2	27 November 2000
		AU 656958 B2	23 February 1995
		NZ 242290 A	22 December 1994
		CA 2107084 A1	16 October 1992
		EP 0586393 A1	16 March 1994
		DE 69225970 T2	15 October 1998
		GB 9319695 D0	01 December 1993
		HU T67924 A	23 March 1995
		OA 9912 A	15 September 1994
		US 5439910 A	08 August 1995
		GB 2270075 B	04 January 1995
		AT 167476 T	15 July 1998
		GB 2270075 A	02 March 1994
		EP 0586393 B1	17 June 1998
		KR 100225619 B1	15 October 1999
		DE 69225970 D1	23 July 1998
		HU 9302795 D0	28 January 1994
		JP H06507394 A	25 August 1994
WO 2008104101 A1	04 September 2008	None	

国际检索报告

国际申请号 PCT/CN2017/072557

A. 主题的分类

C07D 275/03(2006.01)i; A01N 43/80(2006.01)i; A01P 1/00(2006.01)i; A01P 3/00(2006.01)i; A01P 7/04(2006.01)i; A01P 7/02(2006.01)i

按照国际专利分类(IPC)或者同时按照国家分类和IPC两种分类

B. 检索领域

检索的最低限度文献(标明分类系统和分类号)

C07D; A01N; A01P

包含在检索领域中的除最低限度文献以外的检索文献

在国际检索时查阅的电子数据库(数据库的名称，和使用的检索词（如使用）)

VEN, CNABS, CNKI, Caplus, Registry: 肟醚，甲氧基丙烯酸酯，杀虫，杀菌，杀螨，异噻唑，Strobilurins, fungicid, acaridid, pesticid, insecticid, imino, isothiazole, structure search

C. 相关文件

类 型*	引用文件，必要时，指明相关段落	相关的权利要求
X	CN 1065658 A (帝国化学工业公司) 1992年 10月 28日 (1992-10-28) 见权利要求1-10，第7页第2段，表1，第34页第13行至第37页第3行，第47页图解1	1、4-11
Y	CN 1065658 A (帝国化学工业公司) 1992年 10月 28日 (1992-10-28) 见权利要求1-10，第7页第2段，表1，第34页第13行至第37页第3行，第47页图解1	2-3
X	CN 1042900 A (帝国化学工业公司) 1990年 6月 13日 (1990-06-13) 参见权利要求1-8，第50页第11行-第53页第19行，反应式1和反应式2	1、4-11
Y	CN 1042900 A (帝国化学工业公司) 1990年 6月 13日 (1990-06-13) 参见权利要求1-8，第50页第11行-第53页第19行，反应式1和反应式2	2-3
X	CN 1191670 A (化工部沈阳化工研究院等) 1998年 9月 2日 (1998-09-02) 参见权利要求1-10，说明书第5页最后一段-第6页第6行	1、4-11
Y	CN 1191670 A (化工部沈阳化工研究院等) 1998年 9月 2日 (1998-09-02) 参见权利要求1-10	2-3
X	CN 1306506 A (诺瓦提斯公司) 2001年 8月 1日 (2001-08-01) 参见权利要求1-8，说明书第2页第24行至第3页第5行	1、4-5

☑ 其余文件在C栏的续页中列出。 ☑ 见同族专利附件。

* 引用文件的具体类型：

"A" 认为不特别相关的表示了现有技术一般状态的文件

"E" 在国际申请日的当天或之后公布的在先申请或专利

"L" 可能对优先权要求构成怀疑的文件，或为确定另一篇引用文件的公布日而引用的或者因其他特殊理由而引用的文件（如具体说明的）

"O" 涉及口头公开、使用、展览或其他方式公开的文件

"P" 公布日先于国际申请日但迟于所要求的优先权日的文件

"T" 在申请日或优先权日之后公布，与申请不相抵触，但为了理解发明之理论或原理的在后文件

"X" 特别相关的文件，单独考虑该文件，认定要求保护的发明不是新颖的或不具有创造性

"Y" 特别相关的文件，当该文件与另一篇或者多篇该类文件结合并且这种结合对于本领域技术人员为显而易见时，要求保护的发明不具有创造性

"&" 同族专利的文件

国际检索实际完成的日期	国际检索报告邮寄日期
2017年 4月 17日	2017年 5月 8日
ISA/CN的名称和邮寄地址 中华人民共和国国家知识产权局(ISA/CN) 中国北京市海淀区蓟门桥西土城路6号 100088 传真号 (86-10)62019451	受权官员 沙磊 电话号码 (86-10)62084377

表 PCT/ISA/210 (第2页) (2009年7月)

C. 相关文件

类 型*	引用文件，必要时，指明相关段落	相关的权利要求
Y	CN 1306506 A (诺瓦提斯公司) 2001年 8月 1日 (2001-08-01) 参见权利要求1-8，说明书第2页第24行至第3页第5行	2-3
X	CA 2005345 A1 (HOFFMANN LA ROCHE) 1990年 6月 29日 (1990-06-29) 参见权利要求1-15	1、4-5
Y	CA 2005345 A1 (HOFFMANN LA ROCHE) 1990年 6月 29日 (1990-06-29) 参见权利要求1-15	2-3
Y	WO 9218487 A1 (IMPERIAL CHEMICAL INDUSTRIES PLC等) 1992年 10月 29日 (1992-10-29) 参见权利要求1、13	2-3
Y	WO 2008104101 A1 (沈阳化工研究院等) 2008年 9月 4日 (2008-09-04) 参见合成实施例	2-3

国际检索报告
关于同族专利的信息

国际申请号
PCT/CN2017/072557

检索报告引用的专利文件			公布日（年/月/日）	同族专利			公布日（年/月/日）
CN	1065658	A	1992年 10月 28日	EP	0569384	A1	1993年 11月 18日
				GB	9200635	D0	1992年 3月 11日
				US	5342837	A	1994年 8月 30日
				IE	920144	A1	1992年 7月 29日
				MA	22400	A1	1992年 10月 1日
				DE	69211983	T2	1996年 11月 21日
				DK	0569384	T4	2000年 12月 4日
				AP	9200348	D0	1992年 1月 31日
				AT	139993	T	1996年 7月 15日
				DE	69211983	T3	2000年 12月 28日
				PT	100072	A	1993年 3月 31日
				DK	0569384	T3	1996年 11月 18日
				WO	9213830	A1	1992年 8月 20日
				EP	0569384	B1	1996年 7月 3日
				ES	2088572	T5	2001年 1月 1日
				EP	0569384	B2	2000年 10月 4日
				JP	H06504538	A	1994年 5月 26日
				ES	2088572	T3	1996年 8月 16日
				US	5221691	A	1993年 6月 22日
				AU	1161992	A	1992年 9月 7日
				IL	100671	D0	1992年 9月 6日
				DE	69211983	D1	1996年 8月 8日
CN	1042900	A	1990年 6月 13日	HU	T52030	A	1990年 6月 28日
				LV	10082	A	1994年 5月 10日
				AR	247741	A1	1995年 3月 31日
				DE	68905765	D1	1993年 5月 6日
				GR	3007535	T3	1993年 8月 31日
				EP	0506149	A2	1992年 9月 30日
				IE	893508	L	1990年 5月 21日
				DE	68928783	D1	1998年 9月 17日
				ES	2054025	T5	1998年 2月 16日
				KR	0133666	B1	1998年 4月 21日
				EP	0370629	A1	1990年 5月 30日
				JP	H02188565	A	1990年 7月 24日
				US	5432197	A	1995年 7月 11日
				DK	584789	D0	1989年 11月 21日
				CN	1024005	C	1994年 3月 16日
				EP	0506149	A3	1993年 12月 1日
				DK	584789	A	1990年 5月 22日
				AU	627239	B2	1992年 8月 20日
				IE	64709	B1	1995年 8月 23日
				ES	2118769	T3	1998年 10月 1日
				PT	92359	A	1990年 5月 31日
				RU	2024496	C1	1994年 12月 15日
				AP	8900147	D0	1990年 1月 31日
				US	5763640	A	1998年 6月 9日
				ID	1026	B	1996年 10月 21日
				PT	92359	B	1998年 7月 31日
				AU	4430889	A	1990年 5月 17日
				US	5371084	A	1994年 12月 6日

国际检索报告
关于同族专利的信息

国际申请号
PCT/CN2017/072557

检索报告引用的专利文件			公布日（年/月/日）	同族专利			公布日（年/月/日）
				NZ	231242	A	1991年 5月 28日
				IL	92200	A	1994年 1月 25日
				EP	0370629	B2	1998年 1月 7日
				PL	160277	B1	1993年 2月 26日
				DE	68905765	T3	1998年 3月 26日
				DK	174963	B1	2004年 4月 5日
				AT	169616	T	1998年 8月 15日
				EP	0370629	B1	1993年 3月 31日
				EP	0506149	B1	1998年 8月 12日
				DE	68905765	T2	1993年 7月 8日
				CA	2003480	A1	1990年 5月 21日
				CZ	282034	B6	1997年 4月 16日
				US	5055471	A	1991年 10月 8日
				DE	68928783	T2	1998年 12月 24日
				PL	162219	B1	1993年 9月 30日
				CZ	8906590	A3	1997年 1月 15日
				GB	8924122	D0	1989年 12月 13日
				HU	204491	B	1992年 1月 28日
				GR	3025912	T3	1998年 4月 30日
				SK	279372	B6	1998年 10月 7日
				AP	127	A	1991年 3月 20日
CN	1191670	A	1998年 9月 2日	CN	1062711	C	2001年 3月 7日
				US	6177462	B1	2001年 1月 23日
CN	1306506	A	2001年 8月 1日	ZA	200006595	B	2001年 11月 29日
				EP	1095013	A1	2001年 5月 2日
				CA	2332886	A1	2000年 1月 27日
				ZA	200006595	A	2001年 11月 29日
				PL	344999	A1	2001年 11月 19日
				AT	243190	T	2003年 7月 15日
				HU	0102678	A3	2002年 3月 28日
				BR	9912089	A	2001年 4月 10日
				AU	5037899	A	2000年 2月 7日
				HU	0102678	A2	2001年 11月 28日
				AR	020603	A1	2002年 5月 22日
				JP	2002520383	A	2002年 7月 9日
				DE	69908946	T2	2004年 7月 1日
				GT	199900106	A	2000年 12月 30日
				US	2001018452	A1	2001年 8月 30日
				TR	200003715	T2	2001年 7月 23日
				EP	1095013	B1	2003年 6月 18日
				IL	139373	D0	2001年 11月 25日
				WO	0003974	A1	2000年 1月 27日
				TW	476745	B	2002年 2月 21日
				DE	69908946	D1	2003年 7月 24日
CA	2005345	A1	1990年 6月 29日	DK	206290	D0	1990年 8月 28日
				AT	117983	T	1995年 2月 15日
				EP	0403618	B2	2004年 4月 28日
				PT	92753	A	1990年 6月 29日
				EP	0403618	B1	1995年 2月 1日
				PT	92753	B	1995年 12月 29日

国际检索报告
关于同族专利的信息

国际申请号
PCT/CN2017/072557

检索报告引用的专利文件			公布日 (年/月/日)	同族专利			公布日 (年/月/日)
				JP	H03503056	A	1991年 7月 11日
				FI	904230	A0	1990年 8月 27日
				BR	8907287	A	1991年 3月 12日
				DE	58908972	D1	1995年 3月 16日
				HU	216144	B	1999年 4月 28日
				NO	903771	A	1990年 8月 28日
				KR	100187541	B1	1999年 6月 1日
				AU	4639089	A	1990年 8月 1日
				WO	9007493	A1	1990年 7月 12日
				ES	2067570	T3	1995年 4月 1日
				MX	9202638	A	1992年 6月 30日
				HU	T55951	A	1991年 7月 29日
				EP	0403618	A1	1990年 12月 27日
				DK	206290	A	1990年 8月 28日
				NZ	231891	A	1992年 8月 26日
				NO	173543	C	1993年 12月 29日
				HU	900284	D0	1991年 5月 28日
				NO	173543	B	1993年 9月 20日
				NO	903771	D0	1990年 8月 28日
				JP	2907540	B2	1999年 6月 21日
WO	9218487	A1	1992年 10月 29日	HU	213320	B	1997年 5月 28日
				BR	9205902	A	1994年 11月 8日
				AU	1538092	A	1992年 11月 17日
				JP	3112479	B2	2000年 11月 27日
				AU	656958	B2	1995年 2月 23日
				NZ	242290	A	1994年 12月 22日
				CA	2107084	A1	1992年 10月 16日
				EP	0586393	A1	1994年 3月 16日
				DE	69225970	T2	1998年 10月 15日
				GB	9319695	D0	1993年 12月 1日
				HU	T67924	A	1995年 3月 23日
				OA	9912	A	1994年 9月 15日
				US	5439910	A	1995年 8月 8日
				GB	2270075	B	1995年 1月 4日
				AT	167476	T	1998年 7月 15日
				GB	2270075	A	1994年 3月 2日
				EP	0586393	B1	1998年 6月 17日
				KR	100225619	B1	1999年 10月 15日
				DE	69225970	D1	1998年 7月 23日
				HU	9302795	D0	1994年 1月 28日
				JP	H06507394	A	1994年 8月 25日
WO	2008104101	A1	2008年 9月 4日		无		