



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 114364663 B

(45) 授权公告日 2024.07.05

(21) 申请号 202080059806.1

(22) 申请日 2020.06.30

(65) 同一申请的已公布的文献号
申请公布号 CN 114364663 A

(43) 申请公布日 2022.04.15

(30) 优先权数据
19184093.3 2019.07.03 EP

(85) PCT国际申请进入国家阶段日
2022.02.23

(86) PCT国际申请的申请数据
PCT/EP2020/068324 2020.06.30

(87) PCT国际申请的公布数据
W02021/001331 EN 2021.01.07

(73) 专利权人 拜耳公司
地址 德国勒沃库森

(72) 发明人 J·杜弗尔 L·尼古拉斯
土屋知己 D·伯尼尔
T·克诺博罗齐 S·布鲁内特

(74) 专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司 11285
专利代理师 邹琴琴 钟守期

(51) Int.Cl.
C07D 333/38 (2006.01)
A01N 43/10 (2006.01)
A01P 1/00 (2006.01)
A01N 53/00 (2006.01)

(56) 对比文件
CN 112601744 A, 2021.04.02
CN 112638893 A, 2021.04.09
CN 112638894 A, 2021.04.09

审查员 刘露

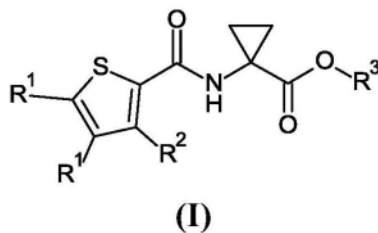
权利要求书4页 说明书86页

(54) 发明名称

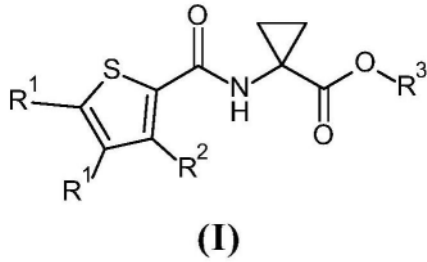
作为杀微生物剂的取代的噻吩甲酰胺及其衍生物

(57) 摘要

本公开内容涉及式(I)的取代的噻吩甲酰胺衍生物、其用于防治植物病原性微生物的用途和包含其的组合物。



1. 式 (I) 的化合物:



其中

R^1 为溴原子或氯原子;

R^2 选自溴原子、氯原子、碘原子和氟原子;

R^3 选自氢原子; C_1-C_6 -烷基; C_1-C_6 -卤代烷基; C_1-C_6 -氰基烷基; C_2-C_6 -烯基; C_2-C_6 -炔基; C_3-C_8 -环烷基; 苄基; $-C_1-C_6$ -烷基-Si(C_1-C_6 -烷基)₃ 和 $-C_1-C_6$ -烷基环丙基, 并且如果 R^1 和 R^2 均为溴原子, 则 R^3 选自 C_1-C_6 -卤代烷基; C_1-C_6 -氰基烷基; C_2-C_6 -烯基; C_2-C_6 -炔基; C_3-C_8 -环烷基; 苄基; $-C_1-C_6$ -烷基-Si(C_1-C_6 -烷基)₃ 和 $-C_1-C_6$ -烷基环丙基, 并且如果 R^3 选自氢原子和 C_1-C_6 -烷基, 则 R_2 选自溴原子和碘原子;

条件是, 当 R^1 为氯原子时, R^2 不为氯原子。

2. 根据权利要求 1 所述的化合物, 其中 R^1 为氯原子。

3. 根据权利要求 1 所述的化合物, 其中 R^1 为溴原子。

4. 根据权利要求 1 所述的化合物, 其中 R^2 选自氟原子、氯原子和溴原子。

5. 根据权利要求 4 所述的化合物, 其中 R^1 不同于 R^2 。

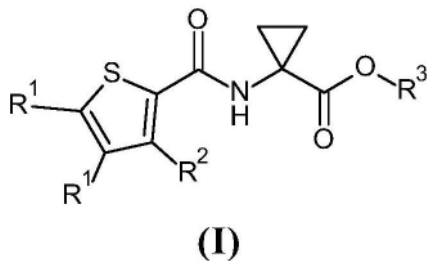
6. 根据权利要求 1 所述的化合物, 其中 R^1 为氯原子且 R^2 为溴原子。

7. 根据权利要求 1 至 6 中任一项所述的化合物, 其中 R^3 选自氢原子、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -氰基烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_8 -环烷基、苄基和 $-C_1-C_6$ -烷基环丙基。

8. 根据权利要求 1 至 6 中任一项所述的化合物, 其中 R^3 选自氢原子、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -氰基烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_8 -环烷基。

9. 根据权利要求 1 至 6 中任一项所述的化合物, 其中 R^3 选自氢原子和 C_1-C_6 -烷基。

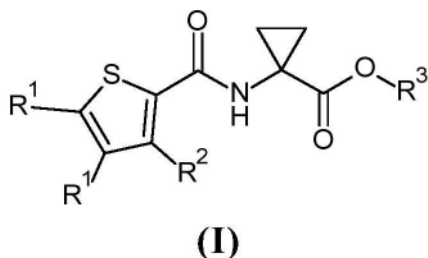
10. 式 (I) 的化合物:



其中:

实施例编号	R ¹	R ²	R ³
I.03	Cl	Br	Et
I.04	Cl	I	Et
I.05	Cl	I	H
I.06	Br	I	Et
I.07	Br	I	Me
I.08	Br	I	H
I.09	Br	Cl	Et
I.10	Br	Cl	Me
I.11	Br	Br	Me
I.12	Cl	Br	Me
I.13	Br	Cl	H
I.14	Br	Br	H
I.15	Cl	Br	H
I.16	Br	F	Me

11. 式 (I) 的化合物在作物保护中用于防治植物或植物部位上的植物病原性真菌和/或细菌的用途:



其中

- R¹为溴原子或氯原子;
- R²选自溴原子、氯原子、碘原子和氟原子;
- R³选自氢原子;C₁-C₆-烷基;C₁-C₆-卤代烷基;C₁-C₆-氰基烷基;C₂-C₆-烯基;C₂-C₆-炔基;
C₃-C₈-环烷基;苄基;-C₁-C₆-烷基-Si(C₁-C₆-烷基)₃和-C₁-C₆-烷基环丙基;
- 条件是,当R¹为氯原子时,R²不为氯原子。

12. 根据权利要求11所述的用途,其中R¹为氯原子。

13. 根据权利要求11所述的用途,其中R¹为溴原子。

14. 根据权利要求11所述的用途,其中R²选自氟原子、氯原子和溴原子。

15. 根据权利要求14中任一项所述的用途,其中R¹不同于R²。

16. 根据权利要求11所述的用途,其中R¹为氯原子且R²选自氟原子和氯原子。

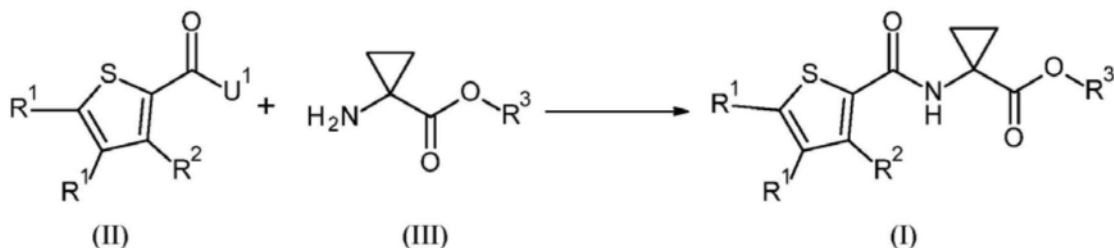
17. 根据权利要求11所述的用途,其中 R^1 为氯原子且 R^2 为溴原子。

18. 根据权利要求11至17中任一项所述的用途,其中 R^3 选自氢原子; C_1-C_6 -烷基; C_1-C_6 -卤代烷基; C_1-C_6 -氰基烷基; C_2-C_6 -烯基; C_2-C_6 -炔基; C_3-C_8 -环烷基;苄基; $-C_1-C_6$ -烷基-Si(C_1-C_6 -烷基)₃和 $-C_1-C_6$ -烷基环丙基。

19. 根据权利要求11至17中任一项所述的用途,其中 R^3 选自氢原子; C_1-C_6 -烷基; C_1-C_6 -卤代烷基; C_1-C_6 -氰基烷基; C_2-C_6 -烯基; C_2-C_6 -炔基; C_3-C_8 -环烷基。

20. 根据权利要求11至17中任一项所述的用途,其中 R^3 选自氢原子和 C_1-C_6 -烷基。

21. 一种制备如权利要求1所述的式(I)的化合物的方法,其包括以下步骤:将式(II)的化合物或其盐与式(III)的化合物或其盐进行反应,以提供式(I)的化合物:



其中

R^1 、 R^2 和 R^3 如权利要求1所述;并且

U^1 为卤素原子、羟基或 C_1-C_6 -烷氧基。

22. 一种制备如权利要求1所述的式(I)的化合物的方法,其包括以下步骤:将式(IV)的化合物或其盐进行溴化或氯化,以提供式(I)的化合物:



其中

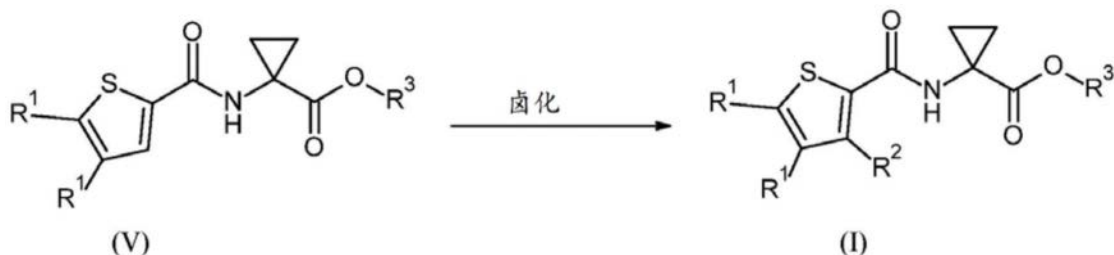
R^1 、 R^2 和 R^3 如权利要求1所述;

U^2 为氢原子、氯原子或溴原子;并且

U^3 为氢原子、氯原子或溴原子;

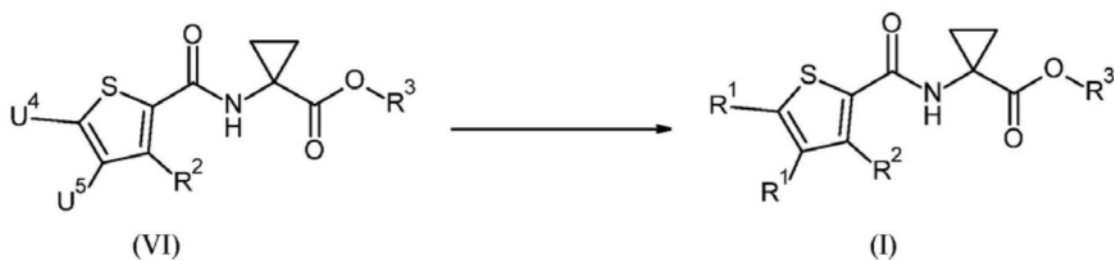
条件是, U^2 或 U^3 中的至少一个为氢原子。

23. 一种制备如权利要求1所述的式(I)的化合物的方法,其包括以下步骤:将式(V)的化合物进行卤化,以提供式(I)的化合物:



其中 R^1 、 R^2 和 R^3 如权利要求1所述。

24. 一种制备如权利要求1所述的式(I)的化合物的方法,其包括以下步骤:将式(VI)的化合物或其盐进行重氮化,然后进行芳族取代,以提供式(I)的化合物:



其中

R^1 、 R^2 和 R^3 如权利要求1所述;

U^4 为氨基、氯原子或溴原子;并且

U^5 为氨基、氯原子或溴原子;

条件是, U^4 或 U^5 中的至少一个为氨基。

25. 组合物,其包含至少一种根据权利要求1至10中任一项所述的式(I)的化合物和至少一种农业上合适的载体。

作为杀微生物剂的取代的噻吩甲酰胺及其衍生物

技术领域

[0001] 本发明涉及取代的噻吩甲酰胺衍生物、其用于防治植物病原性微生物的用途及包含其的组合物。

背景技术

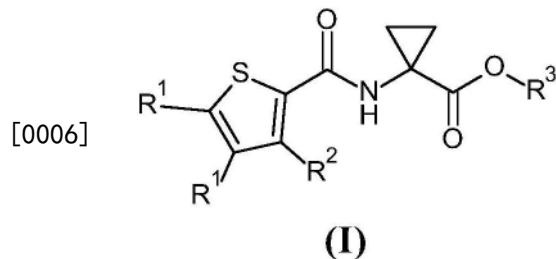
[0002] W02004/024692公开了一些杂环基羰基氨基环丙烷羧酸衍生物可用作杀微生物剂。

[0003] 尽管迄今为止已经开发了许多杀微生物剂,但仍然需要开发新的杀微生物化合物以解决对现代作物保护剂和组合物施加的日益增加的环境和经济要求。例如,这包括改善作用谱、安全性、选择性、施用率、残留物的形成和有利的制备能力。还可能需要有新的化合物来防止抗性的出现。

[0004] 本发明提供了新的化合物,其在这些方面中的至少一些优于已知的化合物和组合物。

发明内容

[0005] 本发明涉及式(I)的化合物以及其盐、N-氧化物和溶剂合物:



[0007] 其中R¹、R²和R³如本文所述。

[0008] 本发明涉及包含至少一种如本文所定义的式(I)的化合物和至少一种农业上合适的载体的组合物。

[0009] 本发明涉及制备如本文所述的式(I)的化合物及其中间体的方法。

[0010] 本发明涉及一种防治植物病原性微生物的方法,其包括以下步骤:将至少一种如本文所定义的式(I)的化合物或如本文所定义的组合物施用于植物、植物部位、种子、果实或植物生长的土壤。

[0011] 定义

[0012] 本文在例如烷基或烷基磺酰基、烷基亚磺酰基、烷硫基、烷基氨基的上下文中使用的术语“烷基”应理解为优选意指支链和非支链的烷基,意指例如甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、仲丁基、戊基、异戊基、己基、庚基、辛基、壬基和癸基及其异构体。

[0013] 本文所用的术语“卤代烷基”应理解为优选意指如上文所定义的支链和非支链的烷基,其中一个或多个氢取代基以相同或不同的方式被卤素替换。尤其优选地,所述卤代烷

基为例如氯甲基、氟丙基、氟甲基、二氟甲基、三氯甲基、2,2,2-三氟乙基、五氟乙基、溴丁基、三氟甲基、碘乙基及其异构体。

[0014] 本文所用的术语“环烷基”是指具有3至8个碳原子的非芳族单环含碳环。饱和环烷基的实例包括但不限于环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基和环癸基。

[0015] 本文所用的术语“杂环基”是指四元、五元或六元饱和或部分不饱和杂环,其含有一至四个独立地选自氧、氮和硫的杂原子。如果环含有一个以上的氧原子,则它们不是直接相邻的。

[0016] 本文所用的术语“卤素”或“卤代”应理解为意指氟、氯、溴或碘。

[0017] 括号中的术语“卤代”(例如“C₁-C₆-(卤代)烷基”)表示任选存在一个或多个可以相同或不同的卤素取代基。

[0018] 本文所用的术语“烯基”应理解为优选意指支链和非支链的烯基,例如乙烯基、丙烯-1-基、丙烯-2-基、丁-1-烯-1-基、丁-1-烯-2-基、丁-2-烯-1-基、丁-2-烯-2-基、丁-1-烯-3-基、2-甲基-丙-2-烯-1-基或2-甲基-丙-1-烯-1-基。

[0019] 本文所用的术语“炔基”应理解为优选意指支链和非支链的炔基,例如,乙炔基、丙-1-炔-1-基、丁-1-炔-1-基、丁-2-炔-1-基或丁-3-炔-1-基。

[0020] 本文所用的术语“芳基”是指包含6至15个碳原子,或6至12个碳原子,优选6至10个碳原子的芳族烃环体系。环体系可为单环或稠合多环(例如,双环或三环)芳族环体系。芳基的实例包括但不限于苯基、萘基、萘基和茚基。还应理解,当所述芳基被一个或多个取代基取代时,所述一个或多个取代基可位于所述芳基环上的任何位置。特别地,在芳基为苯基的情况下,所述一个或多个取代基可占据一个或两个邻位、一个或两个间位、或对位,或这些位置的任何组合。该定义也适用于作为复合取代基(例如,芳氧基)的一部分的芳基。

[0021] 本文所用的术语“芳烷基”是指被如本文所定义的芳基取代的C₁-C₆-烷基。芳烷基的实例包括苄基(-CH₂-C₆H₅)。

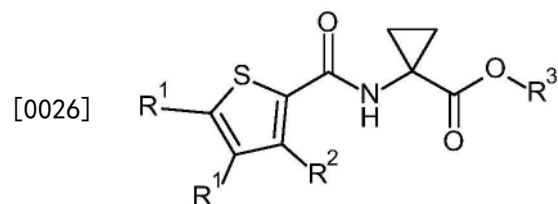
[0022] 本文所用的术语“C₁-C₆”,例如在“C₁-C₆烷基”或“C₁-C₆烷氧基”的定义的上下文中,应理解为表示具有1至6个(即1、2、3、4、5或6个碳原子)有限碳原子数的基团。

[0023] 本文所用的术语“离去基团”应理解为意指在取代或消去反应中从化合物置换的基团,例如卤素原子、三氟甲磺酸酯(“triflate”)基团、烷氧基、甲磺酸酯、对甲苯磺酸酯等。

具体实施方式

[0024] 活性成分

[0025] 本发明涉及式(I)的化合物:



[0027] 其中

[0028] R¹为溴原子或氯原子;

[0029] R^2 选自溴原子、氯原子、碘原子和氟原子；

[0030] R^3 选自氢原子； C_1-C_6 -烷基； C_1-C_6 -卤代烷基； C_1-C_6 -氰基烷基； C_2-C_6 -烯基； C_2-C_6 -炔基； C_3-C_8 -环烷基；芳基；杂芳基；芳烷基； $-C_1-C_6$ -烷基杂芳基；4元、5元或6元杂环基； $-C_1-C_6$ -烷基-Si(C_1-C_6 -烷基)₃和 $-C_1-C_6$ -烷基环丙基，并且如果 R^1 和 R^2 均为溴原子，则 R^3 选自 C_1-C_6 -卤代烷基； C_1-C_6 -氰基烷基； C_2-C_6 -烯基； C_2-C_6 -炔基； C_3-C_8 -环烷基；芳基；杂芳基；芳烷基； $-C_1-C_6$ -烷基杂芳基；4元、5元或6元杂环基； $-C_1-C_6$ -烷基-Si(C_1-C_6 -烷基)₃和 $-C_1-C_6$ -烷基环丙基，并且如果 R^3 选自氢原子和 C_1-C_6 -烷基，则 R_2 选自溴原子和碘原子；

[0031] 条件是，当 R^1 为氯原子时， R^2 不为氯原子。

[0032] 在一个优选的实施方案中， R^1 为氯原子。

[0033] 在另一优选的实施方案中， R^1 为溴原子。

[0034] 在另一优选的实施方案中， R^2 选自氟原子、氯原子和溴原子。

[0035] 在另一优选的实施方案中， R^1 不同于 R^2 。

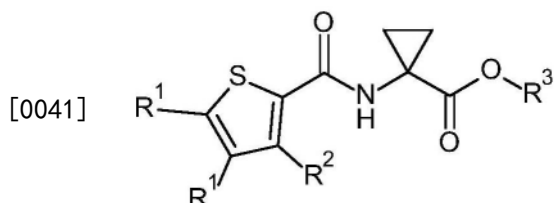
[0036] 在另一优选的实施方案中， R^1 为氯原子且 R^2 为溴原子。

[0037] 在另一实施方案中， R^2 选自溴原子、氯原子和氟原子。

[0038] 在另一实施方案中， R^3 选自氢原子； C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -氰基烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_8 -环烷基、芳烷基和 $-C_1-C_6$ -烷基环丙基，并且优选选自氢原子； C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -氰基烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_8 -环烷基，并且最优选选自氢原子和 C_1-C_6 -烷基。

[0039] 在另一优选的实施方案中， R^1 为氯原子且 R^2 为溴原子且 R^3 选自氢原子； C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -氰基烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_8 -环烷基、芳烷基和 $-C_1-C_6$ -烷基- C_3-C_8 -环丙基，并且优选选自氢原子； C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -氰基烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_8 -环烷基，并且最优选选自氢原子和 C_1-C_6 -烷基。

[0040] 本发明的另一方面为式(I)的化合物：



[0042] 其中

[0043] R^1 为溴原子或氯原子；

[0044] R^2 选自溴原子、氯原子、碘原子和氟原子；

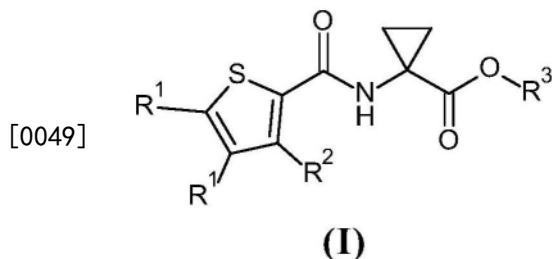
[0045] R^3 选自氢原子； C_1-C_6 -烷基； C_1-C_6 -卤代烷基； C_1-C_6 -氰基烷基； C_2-C_6 -烯基； C_2-C_6 -炔基； C_3-C_8 -环烷基；芳基；杂芳基；芳烷基； $-C_1-C_6$ -烷基杂芳基；4元、5元或6元杂环基； $-C_1-C_6$ -烷基-Si(C_1-C_6 -烷基)₃和 $-C_1-C_6$ -烷基- C_3-C_8 -环烷基，并且如果 R^1 和 R^2 均为溴原子，则 R^3 选自 C_1-C_6 -卤代烷基； C_1-C_6 -氰基烷基； C_2-C_6 -烯基； C_2-C_6 -炔基； C_3-C_8 -环烷基；芳基；杂芳基；芳烷基； $-C_1-C_6$ -烷基杂芳基；4元、5元或6元杂环基； $-C_1-C_6$ -烷基-Si(C_1-C_6 -烷基)₃和 $-C_1-C_6$ -烷基环丙基，并且如果 R^3 选自氢原子和 C_1-C_6 -烷基，则 R_2 选自溴原子和碘原子；

[0046] 条件是，当 R^1 为氯原子时， R^2 不为氯原子。

[0047] 在该方面的一个优选实施方案中， R^1 为氯原子且 R^2 为溴原子且 R^3 选自氢原子、 C_1 -

C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-氰基烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-环烷基、芳烷基和-C₁-C₆-烷基-C₃-C₈-环烷基,并且优选选自氢原子、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-氰基烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-环烷基,并且最优选选自氢原子和C₁-C₆-烷基。

[0048] 本发明的另一方面涉及式(I)的化合物在作物保护中用于防治植物或植物部位上的植物病原性真菌和/或细菌的用途:



[0050] 其中

[0051] R¹为溴原子或氯原子;

[0052] R²选自溴原子、氯原子、碘原子和氟原子;

[0053] R³选自氢原子;C₁-C₆-烷基;C₁-C₆-卤代烷基;C₁-C₆-氰基烷基;C₂-C₆-烯基;C₂-C₆-炔基;C₃-C₈-环烷基;芳基;杂芳基;芳烷基;-C₁-C₆-烷基杂芳基;4元、5元或6元杂环基;-C₁-C₆-烷基-Si(C₁-C₆-烷基)₃和-C₁-C₆-烷基环丙基;

[0054] 条件是,当R¹为氯原子时,R²不为氯原子。

[0055] 在该方面的一个优选实施方案中,R¹为氯原子。

[0056] 在该方面的一个优选实施方案中,R¹为溴原子。

[0057] 在该方面的一个优选实施方案中,R²选自氟原子、氯原子和溴原子。

[0058] 在该方面的一个优选实施方案中,R¹不同于R²。

[0059] 在该方面的一个优选实施方案中,R¹为氯原子且R²选自氟原子和氯原子。

[0060] 在该方面的一个优选实施方案中,R¹为氯原子且R²为溴原子。

[0061] 在该方面的一个优选实施方案中,R³选自氢原子;C₁-C₆-烷基;C₁-C₆-卤代烷基;C₁-C₆-氰基烷基;C₂-C₆-烯基;C₂-C₆-炔基;C₃-C₈-环烷基;芳基;杂芳基;芳烷基;-C₁-C₆-烷基杂芳基;4元、5元或6元杂环基;-C₁-C₆-烷基-Si(C₁-C₆-烷基)₃和-C₁-C₆-烷基环丙基且优选选自氢原子;C₁-C₆-烷基;C₁-C₆-卤代烷基;C₁-C₆-氰基烷基;C₂-C₆-烯基;C₂-C₆-炔基;C₃-C₈-环烷基,并且最优选选自氢原子和C₁-C₆-烷基。

[0062] 在该方面的另一优选的实施方案中,R¹为氯原子且R²为溴原子且R³选自氢原子、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-氰基烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-环烷基、芳烷基和-C₁-C₆-烷基-C₃-C₈-环丙基,并且优选选自氢原子、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-氰基烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-环烷基,并且最优选选自氢原子和C₁-C₆-烷基。

[0063] 在该方面的另一优选的实施方案中,

[0064] R¹为溴原子或氯原子;

[0065] R²选自溴原子、氯原子和氟原子;

[0066] R³选自氢原子;C₁-C₆-烷基;C₁-C₆-卤代烷基;C₁-C₆-氰基烷基;C₂-C₆-烯基;C₂-C₆-炔基;C₃-C₈-环烷基;芳基;杂芳基;芳烷基;-C₁-C₆-烷基杂芳基;4元、5元或6元杂环基;-C₁-C₆-烷基-Si(C₁-C₆-烷基)₃和-C₁-C₆-烷基环丙基;

[0067] 条件是,当R¹为氯原子时,R²不为氯原子。

[0068] 在该方面的另一优选的实施方案中,

[0069] R¹为溴原子或氯原子;

[0070] R²选自溴原子、氯原子和氟原子;

[0071] R³选自氢原子、C₁-C₆-烷基、C₃-C₈-环烷基和芳烷基,

[0072] 条件是,当R¹为氯原子时,R²不为氯原子。

[0073] 在该方面的另一优选的实施方案中,

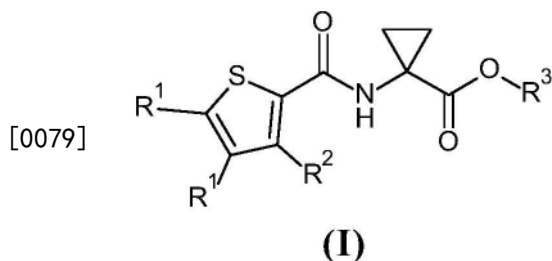
[0074] R¹为溴原子或氯原子;

[0075] R²选自溴原子、氯原子和氟原子;

[0076] R³选自氢原子、C₁-C₆-烷基、C₃-C₈-环烷基和芳烷基,

[0077] 条件是,当R¹为氯原子时,R²不为氯原子,并且条件是,当R¹为溴原子时,R²不为溴原子。

[0078] 本发明的另一方面涉及式(I)的化合物在作物保护中用于防治植物或植物部位上的植物病原性真菌和/或细菌的用途:



[0080] 其中

[0081] R¹为溴原子或氯原子;

[0082] R²选自溴原子、氯原子、碘原子和氟原子;

[0083] R³选自氢原子;C₁-C₆-烷基;C₁-C₆-卤代烷基;C₁-C₆-氰基烷基;C₂-C₆-烯基;C₂-C₆-炔基;C₃-C₈-环烷基;芳基;杂芳基;芳烷基;-C₁-C₆-烷基杂芳基;4元、5元或6元杂环基;-C₁-C₆-烷基-Si(C₁-C₆-烷基)₃和-C₁-C₆-烷基-C₃-C₈-环烷基;

[0084] 条件是,当R¹为氯原子时,R²不为氯原子。

[0085] 在该方面的一个优选实施方案中,R¹为氯原子且R²为溴原子且R³选自氢原子、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-氰基烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-环烷基、芳烷基和-C₁-C₆-烷基-C₃-C₈-环烷基,并且优选选自氢原子、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-氰基烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-环烷基,并且最优选选自氢原子和C₁-C₆-烷基。

[0086] 本文中不涵盖由与自然法则相悖以及本领域技术人员基于他/她的专业知识将因此排除的组合所得到的化合物。例如,排除具有三个或更多个相邻氧原子的环结构。

[0087] 根据取代基的性质,式(I)的化合物可以不同立体异构体的形式存在。这些立体异构体为例如对映体、非对映体、阻转异构体或几何异构体。因此,本发明涵盖纯的立体异构体和这些异构体的任何混合物。当化合物可以平衡状态的两种以上的互变异构体形式存在时,借助于一种互变异构描述提及的化合物应被视为包括所有互变异构体形式。

[0088] 根据化合物中双键的数量,本发明的任意化合物还可以一种或多种几何异构体的形式存在。根据关于双键或环的取代基的性质,几何异构体可以顺式(=Z-)或反式(=E-)

形式存在。因此,本发明同样涉及所有的几何异构体以及所有比例的所有可能的混合物。

[0089] 式(I)的化合物可适当地为其游离形式、盐形式、N-氧化物形式或溶剂合物形式(例如,水合物)。

[0090] 根据取代基的性质,式(I)的化合物可以游离化合物和/或其盐(如农业化学上的活性盐)的形式存在。

[0091] 农业化学上的活性盐包括无机酸和有机酸的酸加成盐以及常规碱的盐。无机酸的实例为氢卤酸(如氢氟酸、氢氯酸、氢溴酸和氢碘酸)、硫酸、磷酸和硝酸,以及酸式盐(如硫酸氢钠和硫酸氢钾)。有用的有机酸包括,例如,甲酸、碳酸和烷酸(如乙酸、三氟乙酸、三氯乙酸和丙酸),以及乙醇酸、硫氰酸、乳酸、琥珀酸、柠檬酸、苯甲酸、肉桂酸、草酸、具有6至20个碳原子的饱和或单不饱和或二不饱和的脂肪酸、烷基硫酸单酯、烷基磺酸(具有碳原子为1至20个的直链或支链烷基基团的磺酸)、芳基磺酸或芳基二磺酸(带有一个或两个磺酸基团的芳族基团,如苯基和萘基)、烷基膦酸(具有碳原子为1至20个的直链或支链烷基基团的膦酸)、芳基膦酸或芳基二膦酸(带有一个或两个膦酸基团的芳族基团,如苯基和萘基),其中烷基和芳基基团可带有其他取代基,例如对甲苯磺酸、水杨酸、对氨基水杨酸、2-苯氧基苯甲酸、2-乙酰氧基苯甲酸等。

[0092] 式(I)的化合物或其盐的溶剂合物为化合物与溶剂的化学计量组合物。

[0093] 式(I)的化合物可以多种结晶和/或无定形形式存在。结晶形式包括未溶剂化的结晶形式、溶剂合物和水合物。

[0094] 本发明涉及表中公开的任意式(I)的化合物以及其在作物保护(即,用于防治植物或植物部位上的植物病原性真菌和/或细菌和/或用于防治线虫)中的用途。

[0095] 本发明的另一方面涉及包含至少一种本发明的式(I)的化合物和至少一种农业上合适的助剂的组合物。

[0096] 本发明的另一个方面涉及防治细菌和/或真菌疾病和/或防治线虫的方法,其包括以下步骤:向植物、植物部位、种子、果实或植物生长的土壤施用至少一种本发明式(I)的化合物或本发明的组合物。

[0097] 本发明的另一方面涉及本发明的化合物或本发明的组合物防治细菌和/或真菌病害和/或防治线虫的用途。优选将它们用于防治细菌或真菌病害。

[0098] 优选地,本发明的化合物或组合物用于对抗:由白粉病病原体(例如叉丝单囊属(白叉丝单囊壳(*Podosphaera leucotricha*))、单丝壳属(如黄瓜白粉菌(*Sphaerotheca fuliginea*))引起的病害;由锈病病原体(如霜霉属(如疣顶单胞锈菌(*Uromyces appendiculatus*)))引起的病害;由以下病原体引起的病害:卵菌纲,如霜霉属(如寄生霜霉(*Peronospora parasitica*))、疫霉属(如致病疫霉(*Phytophthora infestans*))、单轴霉属(如单轴霉(*Plasmopara viticola*))、假霜霉属(如葎草假霜霉(*Pseudoperonospora humuli*)或黄瓜霜霉病菌(*Pseudoperonospora cubensis*))、腐霉属(如终极腐霉(*Pythium ultimum*));由例如链格孢属(如茄链格孢(*Alternaria solani*))、尾孢菌属(如*Cercospora beticola*)、炭疽菌属(如菜豆炭疽菌(*Colletotrichum lindemuthanium*))、黑星菌属(如苹果黑星菌(*Venturia inaequalis*))引起的叶斑病和叶枯萎病;由细菌病原体引起的病害,例如黄单胞菌属(例如野油菜黄单胞菌野油菜致病变种(*Xanthomonas campestris* pv. *Campestris*))、假单胞菌属(例如番茄细菌性斑点病菌(*Pseudomonas syringae*

pv. Tomato)、欧文氏菌属(如解淀粉欧文氏菌(*Erwinia amylovora*))、Liberibacter(如韧皮部杆菌(*Liberibacter Candidatus*))、青枯菌属(例如青枯病菌(*Ralstonia solanacearum*))。

[0099] 根据本发明的另一方面,本发明的化合物或组合物用作植物防御激活剂。根据本发明的植物防御诱导剂是刺激植物自身防御系统的化合物或组合物。

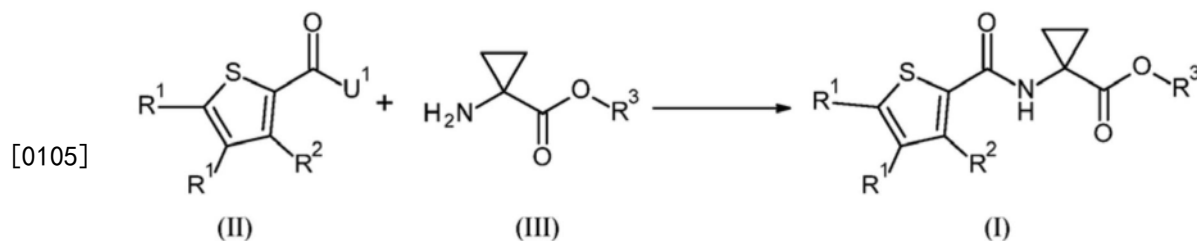
[0100] 制备式(I)的化合物的方法

[0101] 本发明涉及制备式(I)的化合物的方法。式(I)的化合物可以通过类似于已知方法的各种途径(参见其中的参考文献)来制备,并且可以通过下文和实验部分中描述的一种或多种以下合成途径来制备。

[0102] 除非另有说明,在下文中, R^1 、 R^2 和 R^3 具有与上文针对式(I)的化合物给出的相同含义。

[0103] 方法1

[0104] 本文所定义的式(I)的化合物可以通过方法1制备,该方法1包括以下步骤:将式(II)的化合物或其一种盐与式(III)的化合物或其一种盐进行反应,如以下反应方案所示:



方法 1

[0106] 其中 U^1 为卤素原子、羟基或 C_1 - C_6 -烷氧基。

[0107] 当 U^1 表示羟基时,方法1有利地在缩合剂的存在下进行。合适的缩合剂可在由以下物质组成的非限制性列表中选择:酰卤形成剂,如光气、三溴化磷、三氯化磷、五氯化磷、三氯氧磷、草酰氯或亚硫酰氯;酸酐形成剂,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,如 N,N' -二环己基碳二亚胺(DCC)、 N -(3-二甲基氨基丙基)- N' -乙基碳二亚胺盐酸盐(EDC)或其他常用缩合剂,如五氧化二磷、多磷酸、双(2-氧代-3-噁唑烷基)次磷酰氯、1-[双(二甲基氨基)亚甲基]-1H-1,2,3-三唑并[4,5-b]吡啶鎓3-氧化物六氟磷酸盐(HATU)、2-(1H-苯并三唑-1-基)-1,1,3,3-四甲基脒四氟硼酸盐(TBTU)、(1-氰基-2-乙氧基-2-氧代亚乙基氨基氧基)二甲基氨基-吗啉基-碳鎓六氟磷酸盐、 N,N' -羰基-二咪唑、2-乙氧基- N -乙氧基羰基-1,2-二氢喹啉(EEDQ)、三苯基磷/四氯甲烷、4-(4,6-二甲氧基[1.3.5]-三嗪-2-基)-4-甲基吗啉鎓氯化物水合物、双(2-氧代-3-噁唑烷基)次磷酰氯(BOP-Cl)、三吡咯烷基溴化磷六氟磷酸盐(PyBroP)、2-氯-1,3-二甲基咪唑鎓氯化物(DMC)和丙烷膦酸酐(T3P)。

[0108] 当 U^1 表示卤素原子时,方法1有利地在缚酸剂的存在下进行。用于进行方法1的合适缚酸剂在每种情况下为常用于这些反应的所有无机碱和有机碱。优选碱金属碳酸盐,如碳酸铯、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钾、碳酸氢钠;碱土金属乙酸盐,如乙酸钠、乙酸钾、乙酸钙;以及叔胺,如三甲胺、三乙胺、二异丙基乙胺、三丁胺、 N,N -二甲基苯胺、 N -甲基哌啶、 N,N -二甲基吡啶-4-胺、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);或芳族碱,如吡啶。

[0109] 当 U^1 表示 C_1-C_6 -烷氧基时,方法1可任选地在路易斯酸如三甲基铝的存在下用过量的胺组分进行。

[0110] 如果合适,方法1可在碱的存在下并且如果合适在溶剂的存在下,优选在无水条件下进行。

[0111] 用于进行方法1的合适溶剂无特别的限制。它们可为常用的惰性有机溶剂,只要其不溶解化合物以与其反应或表现出与其有任何特定的相互作用即可。优选使用任选卤代的脂族、脂环族或芳族烃,如石油醚、戊烷、己烷、庚烷、环己烷、甲基环己烷、苯、甲苯、二甲苯、十氢萘、ISOPAR™ E或ISOPAR™ G;氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或三氯乙烷;醚,如乙醚、二异丙基醚、甲基叔丁基醚、甲基叔戊基醚、二噁烷、四氢呋喃、2-甲基四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷或苯甲醚;腈,如乙腈、丙腈、正丁腈或异丁腈或苯甲腈;酰胺,如N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基甲酰苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲基磷酰三胺;脲,如1,3-二甲基-3,4,5,6-四氢-2(1H)-嘧啶酮;酯,如乙酸甲酯或乙酸乙酯;亚砷,如二甲基亚砷;或砷,如环丁砷;及其混合物。

[0112] 方法1可在惰性气氛如氩气或氮气气氛中进行。当进行方法1时,每摩尔式(XIV)的化合物可使用1摩尔或过量的式(III)的化合物和1至5摩尔的碱。还可使用以其他比例的反应组分。后处理通过已知方法进行。

[0113] 式(III)的化合物为市售可得的,或可通过熟知的方法制备。

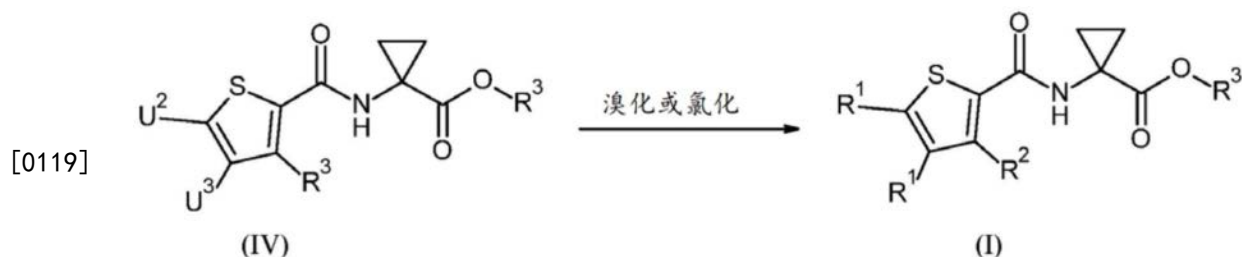
[0114] 其中 U^1 表示羟基的式(II)的化合物为市售可得的,或可由其中 U^1 表示 C_1-C_6 -烷氧基的式(II)的化合物通过熟知的方法如碱性水解来制备,或可通过类似于Beilstein Journal of Organic Chemistry (2007), 3, No.23; Justus Liebigs Annalen der Chemie (1937), 532, 236-49; W02017212010; W02003024961; Journal of Agricultural and Food Chemistry (2007), 55 (18), 7517-7526, 以及其中的其他文献中描述的已知方法类似的各种途径进行制备,或通过一种或多种下文和试验部分中记载的合成途径(例如方法3、方法5或方法6)进行制备。

[0115] 其中 U^1 表示卤素的式(II)的化合物为市售可得的,或可由其中 U^1 表示羟基的式(II)的化合物通过熟知方法来制备。

[0116] 其中 U^1 表示 C_1-C_6 -烷氧基的式(II)的化合物为市售可得的或可由其中 U^1 表示羟基的式(II)的化合物通过熟知方法或方法3、方法5或方法6来制备。

[0117] 方法2

[0118] 本文定义的式(I)的化合物可由式(IV)的化合物或其一种盐通过方法C1经溴化或氯化反应来制备,如以下反应方案所示:



方法 2

[0120] 其中 U^2 为氢原子、氯原子或溴原子且 U^3 为氢原子、氯原子或溴原子,条件是, U^2 或 U^3 中的至少一个为氢原子。

[0121] 可根据已知方法(WO2008109786、WO2007098356)进行方法B2。

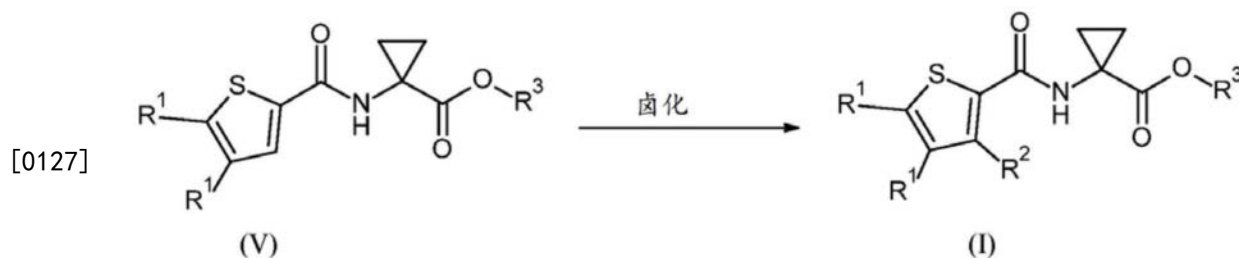
[0122] 方法2在溴化剂或氯化剂的存在下且如果合适,在溶剂的存在下进行。

[0123] 用于进行方法2的合适溴化剂或氯化剂无特别限制,只要它们用于溴化或氯化即可。溴化剂的实例包括溴、N-溴代琥珀酰亚胺和1,3-二溴-5,5-二甲基-2,4-咪唑烷二酮。氯化剂的实例包括N-氯代丁二酰亚胺、硫酰氯和1,3-二氯-5,5-二甲基-2,4-咪唑烷二酮。

[0124] 用于进行方法2的合适溶剂无特别限制。它们可为常用的惰性有机溶剂,只要其不溶解化合物以与其反应或表现出与其有任何特定的相互作用即可。合适的溶剂可为例如方法1中所公开的溶剂。为进行方法2,还可有利的使用有机酸如乙酸或三氟乙酸作为溶剂或共溶剂。为了进行方法2,使用路易斯酸例如氯化锌(II)作为催化剂也是有利的。

[0125] 方法3

[0126] 本文定义的式(I)的化合物可通过方法3由式(V)的化合物或其一种盐经卤化反应来制备,如以下反应方案所示:



方法 3

[0128] 方法3可根据已知的方法进行(Angewandte Chemie, International Edition, 52(16), 4440-4444; 2013; ACS Catalysis, 6(11), 7839-7843; 2016; Journal of the American Chemical Society, 2017, 139, 888; Angewandte Chemie, International Edition, 2014, 53, 7928; Journal of the American Chemical Society, 2018, 140, 2789; WO2008156879; WO2012114285)。

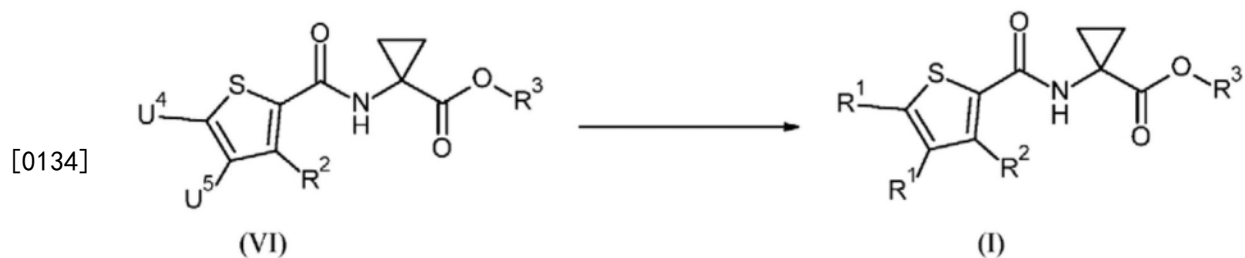
[0129] 方法3在卤化剂的存在下且如果合适,在溶剂的存在下进行。

[0130] 用于进行方法3的合适的卤化剂没有特别限制,只要它们可用于卤化。溴化剂的实例包括溴、N-溴代琥珀酰亚胺和1,3-二溴-5,5-二甲基-2,4-咪唑烷二酮。氯化剂的实例包括N-氯代琥珀酰亚胺、硫酰氯和1,3-二氯-5,5-二甲基-2,4-咪唑烷二酮。溴化剂的实例包括碘、N-碘代琥珀酰亚胺、氯化碘和1,3-二碘-5,5-二甲基-2,4-咪唑烷二酮。氟化剂的实例包括N-氟苯磺酰亚胺。

[0131] 进行方法3的合适溶剂没有特别限制。它们可以是常用的惰性有机溶剂,只要它不溶解与之反应的化合物或表现出任何特定的相互作用。合适的溶剂可以是例如结合方法1公开的一些溶剂。为了进行方法3,使用有机酸如乙酸或三氟乙酸作为溶剂或助溶剂也是有利的。为了进行方法3,使用路易斯酸例如氯化锌(II)作为催化剂也是有利的。为了进行方法3,使用过渡金属催化剂例如钯催化剂也是有利的。为了进行方法3,使用合适的有机金属试剂例如正丁基锂也是有利的。

[0132] 方法4

[0133] 本文定义的式 (I) 的化合物可通过方法4来制备,所述方法4包括以下步骤:将式 (VI) 的化合物或其一种盐进行重氮化,然后进行芳族取代以提供式 (I) 的化合物,如以下反应方案所示:

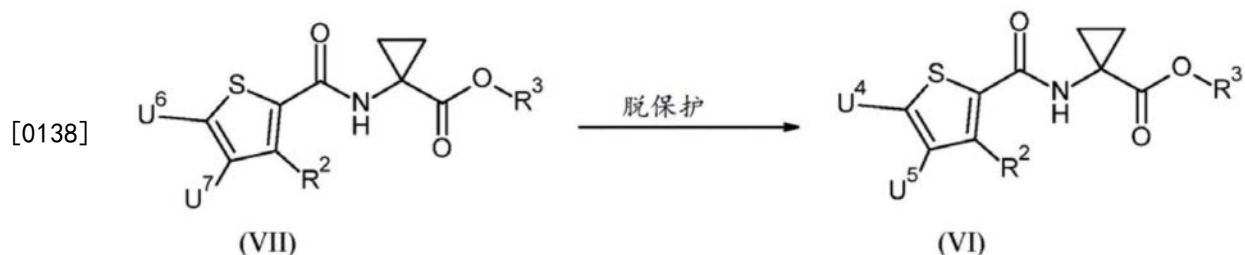


方法 4

[0135] 其中 U^4 为氨基基团、氯原子或溴原子且 U^5 为氨基基团、氯原子或溴原子,条件是, U^4 或 U^5 中的至少一个为氨基基团。

[0136] 方法4可根据已知方法进行(The Chemistry of diazonium and diazo groups; Saul Patai; Wiley-Interscience; 1978; 288-280和645-657; Account of Chemical Research (2018), 51, 496以及其中所引用的文献)。

[0137] 本文定义的式 (VI) 的化合物或其一种盐可通过包括以下步骤的方法来制备:将式 (VII) 的化合物或其一种盐进行重氮化,如以下反应方案所示:

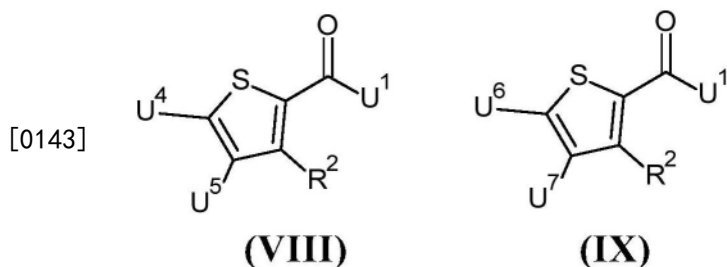


[0139] 其中 U^6 为经保护的氨基、氯原子或溴原子并且 U^7 为经保护的氨基、氯原子或溴原子,条件是, U^6 或 U^7 中的至少一个为经保护的氨基, U^4 为氨基基团、氯原子或溴原子并且 U^5 为氨基基团、氯原子或溴原子,条件是, U^4 或 U^5 中的至少一个为氨基基团。

[0140] 氨基的保护基团的实例包括苄基、4-甲氧基苄基、烯丙基、未取代或取代的 C_1-C_6 -烷基磺酰基、三氟甲基磺酰基、未取代或取代的苯磺酰基、未取代或取代的 C_1-C_6 -烷氧基羰基、未取代或取代的苄氧基羰基、烯丙氧基羰基、乙酰基或三氟乙酰基。

[0141] 脱保护过程可以根据用于去除保护基团的已知方法进行(Greene's Protective Groups in Organic Synthesis; Peter G.M. Wuts; Wiley; Fifth Edition; 2014; 895-1194)。例如,叔丁氧基羰基和苄氧基羰基保护基团可以在酸性介质中除去(例如用盐酸或三氟乙酸)。苄基保护基团可以在催化剂(例如活性炭载钯)存在下用氢气氢解除去。三氟乙酰基可以在碱性介质(例如用碳酸钾或氢氧化锂)中去除。

[0142] 式 (VI) 的化合物可由式 (VIII) 的化合物或其一种盐制备,式 (VII) 的化合物可由式 (IX) 的化合物或其一种盐通过与式 (II) 的化合物在方法1中所述的条件下进行反应来制备:



[0144] 其中 U^4 、 U^5 、 U^6 和 U^7 如本文所定义, U^1 为卤素原子、羟基或 C_1 - C_6 -烷氧基。

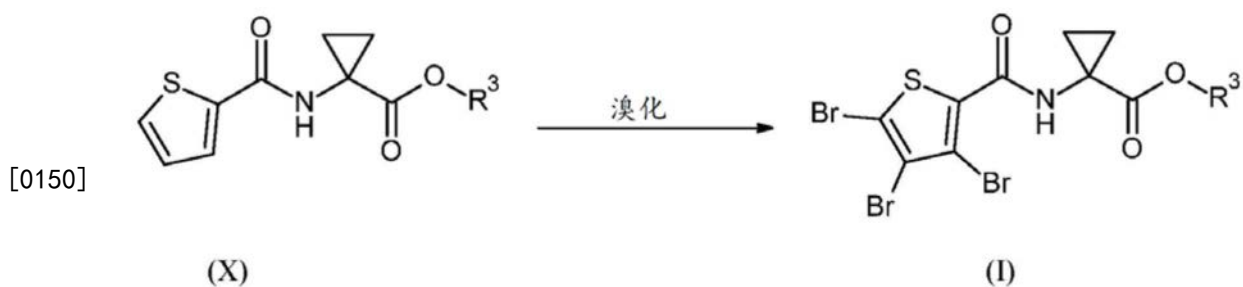
[0145] 式(VIII)的化合物和式(IX)的化合物是可商购的或可以通过熟知的方法用与制备式(II)的化合物所公开的反应条件相似的反应条件来制备。

[0146] 其中 R^3 代表氢原子的式(I)的化合物或其一种盐可由其中 R^3 代表以下基团的式(I)的化合物通过熟知的方法如碱性水解来制备: C_1 - C_6 -烷基; C_1 - C_6 -卤代烷基; C_1 - C_6 -氰基烷基; C_2 - C_6 -烯基; C_2 - C_6 -炔基; C_3 - C_8 -环烷基;芳基;芳烷基;4元、5元或6元杂环基; $-C_1$ - C_6 -烷基-Si(C_1 - C_6 -烷基) $_3$ 和 $-C_1$ - C_6 -烷基环丙基。

[0147] 其中 R^3 代表 C_1 - C_6 -烷基; C_1 - C_6 -卤代烷基; C_1 - C_6 -氰基烷基; C_2 - C_6 -烯基; C_2 - C_6 -炔基; C_3 - C_8 -环烷基;芳基;芳烷基;4元、5元或6元杂环基; $-C_1$ - C_6 -烷基-Si(C_1 - C_6 -烷基) $_3$ 和 $-C_1$ - C_6 -烷基环丙基的式(I)的化合物可由其中 R^3 代表氢原子的式(I)的化合物或其一种盐通过熟知的方法来制备。

[0148] 方法5

[0149] 式(I)的化合物可通过方法5由式(X)的化合物或其一种盐经溴化反应来制备,如以下反应方案所示:



方法5

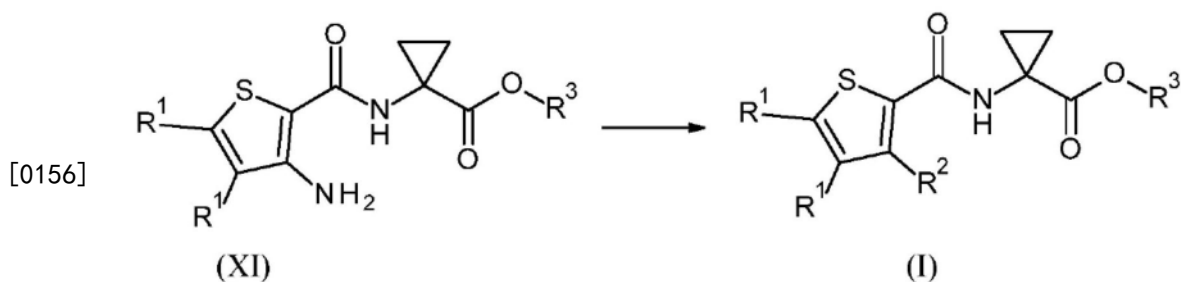
[0151] 方法5在溴化剂的存在下且如果合适,在溶剂的存在下进行。

[0152] 用于进行方法5的合适的溴化剂没有特别限制,只要它们可用于溴化。溴化剂的实例包括N-溴代琥珀酰亚胺、溴和1,3-二溴-5,5-二甲基-2,4-咪唑烷二酮。

[0153] 进行方法5的合适溶剂没有特别限制。它们可以是常用的惰性有机溶剂,只要它不溶解与之反应的化合物或表现出任何特定的相互作用。合适的溶剂可以是例如结合方法2公开的一些溶剂。为了进行方法5,使用有机酸如乙酸或三氟乙酸作为溶剂或助溶剂也是有利的。为了进行方法5,使用路易斯酸例如氯化锌(II)作为催化剂也是有利的。为了进行方法5,使用合适的有机金属试剂例如正丁基锂也是有利的。

[0154] 方法6

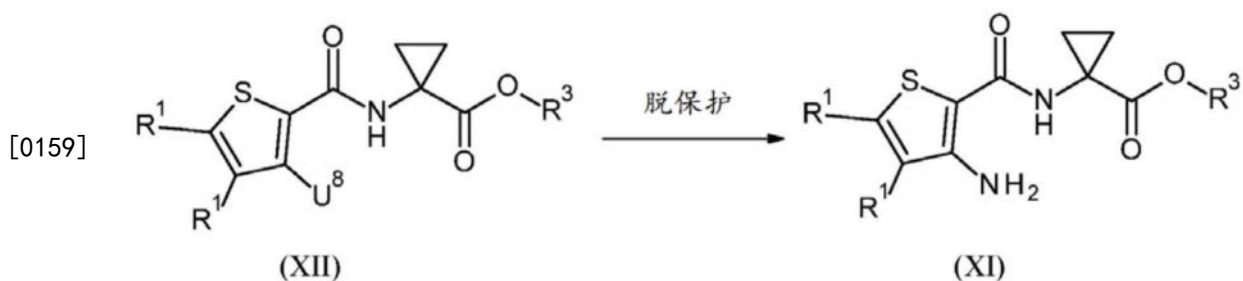
[0155] 式(I)的化合物可通过方法6由式(XI)的化合物制备,如以下反应方案所示:



方法 6

[0157] 方法6可根据已知方法进行(The Chemistry of diazonium and diazo groups; Saul Patai; Wiley-Interscience; 1978; 288-280和645-657; Account of Chemical Research(2018), 51, 496以及其中所引用的文献)。

[0158] 本文所定义的式(XI)的化合物可通过包括以下步骤的方法制备:将式(XII)的化合物进行脱保护反应,如以下反应方案所示:

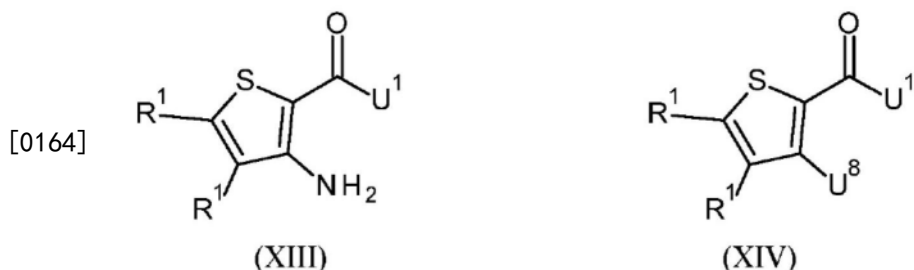


[0160] 其中U⁸为经保护的氨基。

[0161] 氨基的保护基团的实例包括苄基、4-甲氧基苄基、烯丙基、未取代或取代的C₁-C₆-烷基磺酰基、三氟甲基磺酰基、未取代或取代的苯基磺酰基、未取代或取代的C₁-C₆-烷氧基羰基、未取代或取代的苄氧基羰基、烯丙氧基羰基、乙酰基或三氟乙酰基。

[0162] 脱保护过程可以根据用于去除保护基团的已知方法进行(Greene's Protective Groups in Organic Synthesis; Peter G.M. Wuts; Wiley; Fifth Edition; 2014; 895-1194)。例如,叔丁氧基羰基和苄氧基羰基保护基团可以在酸性介质中除去(例如用盐酸或三氟乙酸)。苄基保护基团可以在催化剂(例如活性炭上的钯)存在下用氢气氢解除去。三氟乙酰基可以在碱性介质(例如用碳酸钾或氢氧化锂)中去除。

[0163] 式(XI)的化合物也可由式(XIII)的化合物制备,式(XII)的化合物可由式(XIV)的化合物通过与式(III)的化合物在方法1中所述的条件下进行反应来制备:

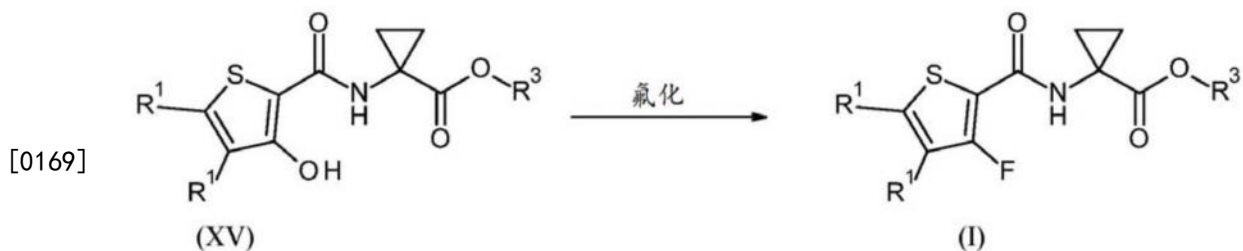


[0165] 其中U⁸如本文所定义且U¹为卤素原子、羟基或C₁-C₆-烷氧基。

[0166] 式(XIII)的化合物和式(XIV)的化合物为市售可得或可以通过熟知的方法与制备式(II)的化合物所公开的反应条件相似的反应条件来制备。

[0167] 方法7

[0168] 式(I)的化合物可通过方法7经氟化反应来制备,如以下方案所示:



方法 7

[0170] 本发明还涉及这样的方法,其中 R^1 、 R^2 和 R^3 如以上内容所述。

[0171] 方法7可以按照已知方法进行(Journal of the American Chemical Society 2011,133,11482和Organic Method Research&Development 2014,18,1041)。

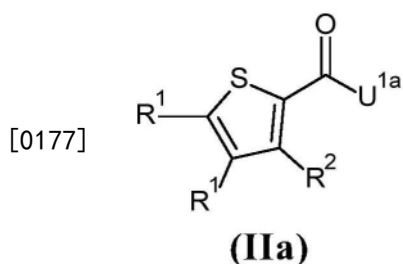
[0172] 本发明的化合物可以根据上述方法制备。然而,应当理解,基于他的一般知识和可获得的出版物,技术人员将能够根据希望合成的本发明的每种化合物的具体情况来调整这些方法。

[0173] 用于制备式(I)的化合物的中间体

[0174] 本发明涉及用于制备式(I)的化合物的中间体

[0175] 除非另有说明,在下文中, R^1 、 R^2 和 R^3 具有与针对上述式(I)的化合物给出的相同含义。

[0176] 提供式(IIa)的化合物:



[0178] 其中 R^1 、 R^2 和 R^3 如本文所定义并且 U^{1a} 为羟基或 C_1 - C_6 -烷氧基,

[0179] 条件是,式(IIa)的化合物不表示:

[0180] -4,5-二氯-3-氟噻吩-2-甲酸甲酯[2166596-88-7],

[0181] -4,5-二氯-3-氟噻吩-2-甲酸[2166596-87-6],

[0182] -4,5-二溴-3-氟噻吩-2-甲酸乙酯[2260624-98-2],

[0183] -4,5-二溴-3-氟噻吩-2-甲酸[1628447-64-2],

[0184] -4,5-二溴-3-氯噻吩-2-甲酸甲酯[1501789-47-4],

[0185] -4,5-二溴-3-碘噻吩-2-甲酸[854626-46-3],

[0186] -4,5-二溴-3-氯噻吩-2-甲酸[503308-99-4],

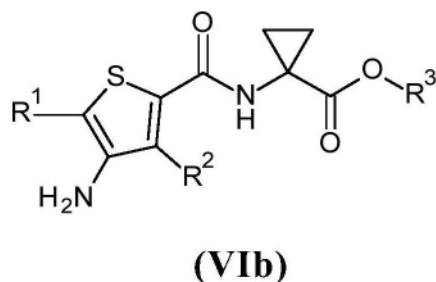
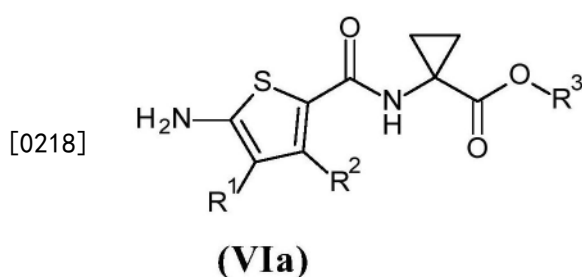
[0187] -4,5-二溴-3-氯噻吩-2-甲酸乙酯[503308-98-3],

[0188] -4,5-二溴-3-氟噻吩-2-甲酸甲酯[395664-58-1],

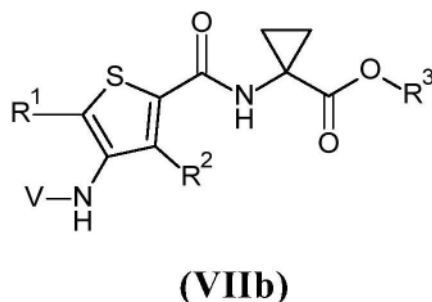
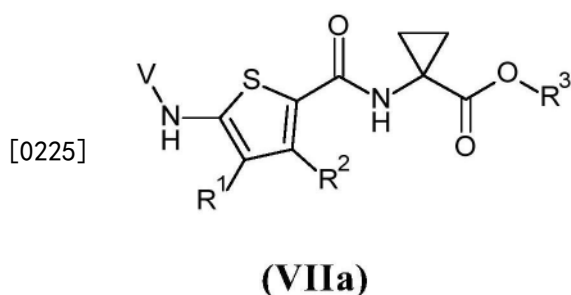
[0189] -3,4,5-三溴噻吩-2-甲酸叔丁酯[62224-27-5],

[0190] -3,4,5-三溴噻吩-2-甲酸乙酯[54113-44-9],

- [0214] -1-[(4,5-二溴-2-噻吩基)羰基]氨基}环丙烷甲酸环丁酯[666857-32-5],
 [0215] -1-[(4,5-二溴-2-噻吩基)羰基]氨基}环丙烷甲酸丙酯[666857-31-4]和
 [0216] -1-[(4,5-二溴-2-噻吩基)羰基]氨基}环丙烷甲酸甲酯[666857-30-3]。
 [0217] 式(VIa)和(VIb)的化合物为本发明的另一方面:

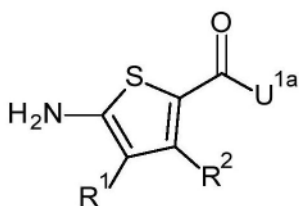


- [0219] 其中
 [0220] R¹为溴原子或氯原子;
 [0221] R²选自溴原子、氯原子、碘原子和氟原子;
 [0222] R³选自C₁-C₆-卤代烷基;C₁-C₆-氰基烷基;C₂-C₆-烯基;C₂-C₆-炔基;C₃-C₈-环烷基;芳基;杂芳基;芳烷基;-C₁-C₆-烷基杂芳基;4元、5元或6元杂环基;-C₁-C₆-烷基-Si(C₁-C₆-烷基)₃和-C₁-C₆-烷基环丙基;
 [0223] 条件是,当R¹为氯原子时,R²不为氯原子。
 [0224] 提供式(VIIa)和(VIIb)的化合物:

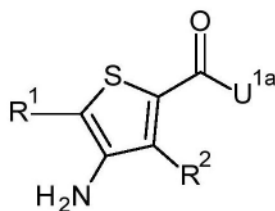


- [0226] 其中
 [0227] R¹为溴原子或氯原子;
 [0228] R²选自溴原子、氯原子、碘原子和氟原子;
 [0229] R³选自C₁-C₆-卤代烷基;C₁-C₆-氰基烷基;C₂-C₆-烯基;C₂-C₆-炔基;C₃-C₈-环烷基;芳基;杂芳基;芳烷基;-C₁-C₆-烷基杂芳基;4元、5元或6元杂环基;-C₁-C₆-烷基-Si(C₁-C₆-烷基)₃和-C₁-C₆-烷基环丙基;
 [0230] 条件是,当R¹为氯原子时,R²不为氯原子。
 [0231] V为苄基、4-甲氧基苄基、烯丙基、未取代或取代的C₁-C₆-烷氧基羰基、未取代或取代的苄氧基羰基、烯丙氧基羰基、乙酰基或三氟乙酰基。
 [0232] 提供式(VIIIa)和(VIIIb)的化合物:

[0233]



(VIIIa)



(VIIIb)

[0234] 其中

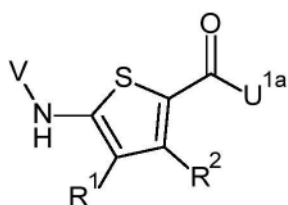
[0235] R^1 为溴原子或氯原子；[0236] R^2 选自溴原子、氯原子、碘原子和氟原子；[0237] U^{1a} 为羟基或 C_1 - C_6 -烷氧基；[0238] 条件是,当 R^1 为氯原子时, R^2 不为氯原子。[0239] 条件是,当 R^1 为溴原子时, R^2 不为氯原子,也不为氟原子。

[0240] 条件是,式(VIIIb)的化合物不表示:

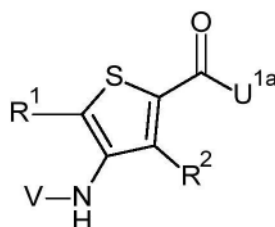
[0241] -4-氨基-3,5-二溴噻吩-2-甲酸乙酯[1394375-09-7]。

[0242] 提供式(IXa)和(IXb)的化合物:

[0243]



(IXa)



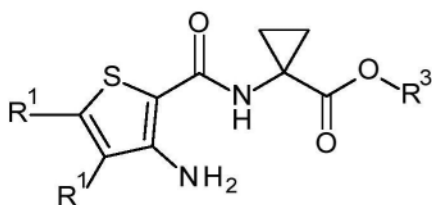
(IXb)

[0244] 其中

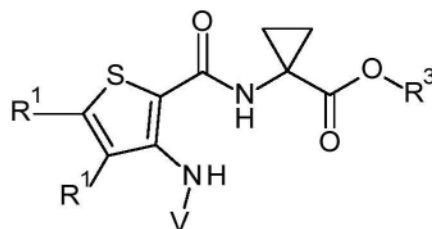
[0245] R^1 为溴原子或氯原子；[0246] R^2 选自溴原子、氯原子、碘原子和氟原子；[0247] V为苄基、4-甲氧基苄基、烯丙基、未取代或取代的 C_1 - C_6 -烷氧基羰基、未取代或取代的苄氧基羰基、烯丙氧基羰基、乙酰基或三氟乙酰基,并且 U^{1a} 为羟基或 C_1 - C_6 -烷氧基。[0248] U^{1a} 为羟基或 C_1 - C_6 -烷氧基；[0249] 条件是,当 R^1 为氯原子时, R^2 不为氯原子,也不为氟原子；[0250] 条件是,当 R^1 为溴原子时, R^2 不为氯原子,也不为氟原子。

[0251] 提供式(XI)和(XIIa)的化合物:

[0252]



(XI)



(XIIa)

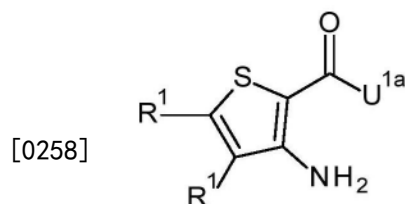
[0253] 其中

[0254] V为苄基、4-甲氧基苄基、烯丙基、未取代或取代的C₁-C₆-烷氧基羰基、未取代或取代的苄氧基羰基、烯丙氧基羰基、乙酰基或三氟乙酰基；

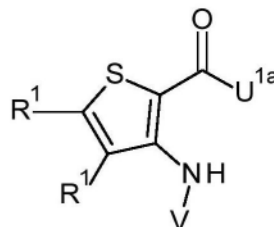
[0255] R¹为溴原子或氯原子；

[0256] R³选自C₁-C₆-卤代烷基；C₁-C₆-氰基烷基；C₂-C₆-烯基；C₂-C₆-炔基；C₃-C₈-环烷基；芳基；杂芳基；芳烷基；-C₁-C₆-烷基杂芳基；4元、5元或6元杂环基；-C₁-C₆-烷基-Si(C₁-C₆-烷基)₃和-C₁-C₆-烷基环丙基。

[0257] 提供式(XIIIa)和(XIVa)的化合物：



(XIIIa)



(XIVa)

[0259] 其中

[0260] R¹为溴原子或氯原子；

[0261] V为苄基、4-甲氧基苄基、烯丙基、未取代或取代的C₁-C₆-烷氧基羰基、未取代或取代的苄氧基羰基、烯丙氧基羰基、乙酰基或三氟乙酰基；并且

[0262] U^{1a}为羟基或C₁-C₆-烷氧基，

[0263] 条件是，式(XIIIa)的化合物不代表：

[0264] -3-氨基-4,5-二氯噻吩-2-甲酸甲酯[1621488-35-4]，

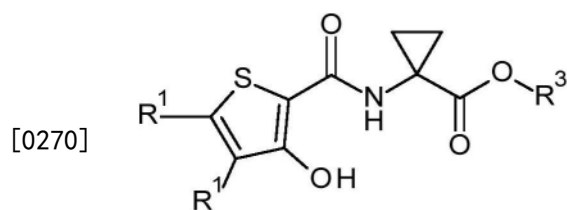
[0265] 并且条件是，式(XIVa)的化合物不代表：

[0266] -3-乙酰氨基-4,5-二氯噻吩-2-甲酸[2090448-72-7]，

[0267] -3-乙酰氨基-4,5-二氯噻吩-2-甲酸甲酯[632356-39-9]，和

[0268] -4,5-二氯-3-[甲氧基羰基]氨基噻吩-2-甲酸甲酯[35707-28-9]。

[0269] 式(XV)的化合物为本发明的另一方面：



(XV)

[0271] 其中

[0272] R¹为溴原子或氯原子；

[0273] R³选自C₁-C₆-卤代烷基；C₁-C₆-氰基烷基；C₂-C₆-烯基；C₂-C₆-炔基；C₃-C₈-环烷基；芳基；杂芳基；芳烷基；-C₁-C₆-烷基杂芳基；4元、5元或6元杂环基；-C₁-C₆-烷基-Si(C₁-C₆-烷基)₃和-C₁-C₆-烷基环丙基。

[0274] 组合物和制剂

[0275] 本发明还涉及一种组合物，特别是用于防治不想要的微生物的组合物，其包含一

种或多种式 (I) 的化合物。所述组合物优选为杀真菌组合物。

[0276] 组合物通常包含一种或多种式 (I) 的化合物和一种或多种可接受的载体, 特别是一种或多种农业上可接受的载体。

[0277] 载体为通常是惰性的天然或合成的固体或液体有机或无机物质。载体通常改善化合物在例如植物、植物部位或种子上的施用。合适的固体载体的实例包括但不限于: 铵盐、天然石粉 (如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、绿坡缕石、蒙脱石和硅藻土), 以及合成石粉 (如细分散的二氧化硅、氧化铝和硅酸盐)。通常用于制备颗粒剂的固体载体的实例包括但不限于: 粉碎并分级的天然岩石 (如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石)、无机和有机粉的合成颗粒, 以及有机材料 (如纸、锯屑、椰壳、玉米穗轴和烟草秸秆) 的颗粒。合适的液体载体的实例包括但不限于水、有机溶剂及其组合。合适的溶剂的实例包括极性和非极性有机化学液体, 例如来自以下类别: 芳族和非芳族烃类 (如环己烷、石蜡、烷基苯、二甲苯、甲苯烷基萘、氯化芳族烃或氯化脂族烃如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷)、醇和多元醇 (其还可以任选地被取代、醚化和/或酯化, 如丁醇或乙二醇)、酮 (如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮)、酯 (包括脂肪与油类) 和 (聚) 醚、未取代和取代的胺、酰胺 (如二甲基甲酰胺)、内酰胺 (如N-烷基吡咯烷酮) 和内酯、砒和亚砒 (如二甲基亚砒)。载体还可以是液化气态增量剂, 即在标准温度和标准压力下呈气态的液体, 例如气溶胶推进剂, 如卤代烃、丁烷、丙烷、氮气和二氧化碳。载体的量通常为组合物重量的1至99.99%, 优选5至99.9%, 更优选10至99.5%, 最优选20至99%。

[0278] 组合物还可包含一种或多种常用于配制组合物 (如农业化学组合物) 的可接受的助剂, 例如一种或多种表面活性剂。

[0279] 表面活性剂可以是离子型 (阳离子型或阴离子型) 或非离子型表面活性剂, 如离子型或非离子型乳化剂、泡沫形成剂、分散剂、润湿剂及其任意混合物。合适的表面活性剂的实例包括但不限于, 聚丙烯酸的盐; 木素磺酸的盐; 苯酚磺酸或萘磺酸的盐; 环氧乙烷和/或环氧丙烷与脂肪醇、脂肪酸或脂肪胺的缩聚物 (聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚, 例如烷基芳基聚乙二醇醚); 取代的酚 (优选烷基酚或芳基酚); 磺基琥珀酸酯的盐; 牛磺酸衍生物 (优选烷基牛磺酸酯); 聚乙氧基化醇或酚的磷酸酯; 多元醇的脂肪酸酯和含有硫酸根、磺酸根、磷酸根的化合物的衍生物 (例如, 烷基磺酸酯、烷基硫酸酯、芳基磺酸酯); 以及蛋白质水解物; 木质素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。当式 (I) 的化合物和/或载体不溶于水并且用水施用时, 通常使用表面活性剂。然后, 表面活性剂的量通常为组合物重量的5%至40%。

[0280] 常用于配制农用化学组合物的助剂的其他实例包括防水剂、干燥剂、粘合剂 (binder) (胶粘剂 (adhesive)、增粘剂、固定剂, 如羧甲基纤维素, 粉末、颗粒或胶乳形式的天然和合成聚合物 (如阿拉伯树胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯)、天然磷脂 (如脑磷脂和卵磷脂) 和合成磷脂、聚乙烯吡咯烷酮、聚乙烯乙酸酯、聚乙烯醇和甲基纤维素)、增稠剂、稳定剂 (例如低温稳定剂、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂或其它改善化学和/或物理稳定性的试剂)、染料或颜料 (如无机颜料, 例如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝; 有机染料, 例如茜素、偶氮和金属酞菁染料)、消泡剂 (例如硅酮消泡剂和硬脂酸镁)、防腐剂 (例如二氯苯和苄醇半缩甲醛)、二次增稠剂 (纤维素衍生物、丙烯酸衍生物、黄原胶、改性粘土以及细分散的二氧化硅)、粘着剂、赤霉素和加工助剂、矿物油和植物油、香料、蜡、营养物 (包括微量营养物, 如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐)、保护胶体、触变物质、渗透剂、螯合剂和络合剂。

[0281] 助剂的选择与式(I)的化合物的预期施用方式和/或物理特性有关。此外,可以选择助剂以赋予组合物或其制备的使用形式特定的特性(技术、物理和/或生物学特性)。助剂的选择可以使得针对具体需求来定制组合物。

[0282] 组合物可以是任何常规形式,如溶液剂(例如水溶液)、乳剂、可湿性粉剂、水基和油基悬浮剂、粉末剂、粉剂、膏剂、可溶性粉剂、可溶性颗粒剂、撒播用颗粒剂、悬乳浓缩剂、用本发明的一种或多种化合物浸渍的天然或合成产品、肥料以及聚合物中的微胶囊剂。式(I)的化合物可以悬浮、乳化或溶解的形式存在。

[0283] 组合物可以作为即用型制剂提供给最终使用者,即可以通过合适的装置如喷雾或撒粉装置将组合物直接施用于植物或种子。或者,组合物可以浓缩物的形式提供给最终使用者,在使用前必须将其稀释,优选用水稀释。

[0284] 组合物可以常规方式制备,例如通过将一种或多种式(I)的化合物与一种或多种合适的助剂(例如上文所公开的)进行混合来制备。

[0285] 组合物通常含有0.01至99重量%,0.05至98重量%,优选0.1至95重量%,更优选0.5至90重量%,最优选1至80重量%的式(I)的化合物。

[0286] 一种或多种化合物和包含其的组合物可以与其他活性成分(如杀真菌剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀昆虫剂、除草剂、肥料、生长调节剂、安全剂或化学信息素)混合。这可以拓宽活性谱或防止抗性发展。已知的杀真菌剂、杀昆虫剂、杀螨剂、杀线虫剂和杀细菌剂的实例公开于《农药手册(Pesticide Manual)》,第17版。

[0287] 本文中以其通用名示出的活性成分是已知的并记载于例如《农药手册》(16th Ed. British Crop Protection Council)或可在互联网中搜索(如www.alanwood.net/pesticides)。

[0288] 在化合物(A)或化合物(B)可以互变异构形式存在的情况下,这种化合物在上文和下文中被理解为在适用的情况下还包括相应的互变异构形式,即使这些在每种情况下都没有具体提及。

[0289] (1)至(15)类的所有命名的混合配伍剂可任选地(如果其官能团允许)与合适的碱或酸形成盐。

[0290] 1) 麦角甾醇生物合成抑制剂,例如(1.001)环丙唑醇(cyproconazole)、(1.002)苯醚甲环唑(difenoconazole)、(1.003)氟环唑(epoxiconazole)、(1.004)环酰菌胺(fenhexamid)、(1.005)苯锈啶(fenpropidin)、(1.006)丁苯吗啉(fenpropimorph)、(1.007)胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)、(1.008)氟喹唑(fluquinconazole)、(1.009)粉唑醇(flutriafol)、(1.010)烯菌灵(imazalil)、(1.011)烯菌灵硫酸盐(imazalil sulfate)、(1.012)种菌唑(ipconazole)、(1.013)叶菌唑(metconazole)、(1.014)腈菌唑(myclobutanil)、(1.015)多效唑(paclobutrazol)、(1.016)咪鲜胺(prochloraz)、(1.017)丙环唑(propiconazole)、(1.018)丙硫菌唑(prothioconazole)、(1.019)氯啉菌酯(pyrisoxazole)、(1.020)螺环菌胺(spiroxamine)、(1.021)戊唑醇(tebuconazole)、(1.022)氟醚唑(tetraconazole)、(1.023)三唑醇(triadimenol)、(1.024)克啉菌(tridemorph)、(1.025)灭菌唑(triticonazole)、(1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇、(1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇、(1.028) (2R)-2-(1-氯环

丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.029) (2R)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.030) (2R)-2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.031) (2S)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.032) (2S)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.033) (2S)-2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.034) (R)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.035) (S)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.036) [3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.037) 1-({(2R,4S)-2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-4-甲基-1,3-二氧戊环-2-基}甲基)-1H-1,2,4-三唑、(1.038) 1-({(2S,4S)-2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-4-甲基-1,3-二氧戊环-2-基}甲基)-1H-1,2,4-三唑、(1.039) 1-[[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基]-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.040) 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基]-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.041) 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基]-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.050) 2-[1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.051) 2-[2-氯-4-(2,4-二氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.052) 2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.053) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.054) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)戊-2-醇、(1.055) 氯氟醚菌唑(Mefentrifluconazole)、(1.056) 2-[[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.057) 2-[[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.058) 2-[[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.059) 5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)甲基)环戊醇、(1.060) 5-(烯丙基硫基)-1-[[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基]-1H-1,2,4-三唑、(1.061) 5-(烯丙基硫基)-1-[[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基]-1H-1,2,4-三唑、(1.062) 5-(烯丙基硫基)-1-[[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-

基]甲基)-1H-1,2,4-三唑、(1.063)N'-(2,5-二甲基-4-[[3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]硫基]苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.064)N'-(2,5-二甲基-4-[[3-(2,2,2-三氟乙氧基)苯基]硫基]苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.065)N'-(2,5-二甲基-4-[[3-(2,2,3,3-四氟丙氧基)苯基]硫基]苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.066)N'-(2,5-二甲基-4-[[3-(五氟乙氧基)苯基]硫基]苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.067)N'-(2,5-二甲基-4-[[3-[(1,1,2,2-四氟乙基)硫基]苯氧基]苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.068)N'-(2,5-二甲基-4-[[3-[(2,2,2-三氟乙基)硫基]苯氧基]苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.069)N'-(2,5-二甲基-4-[[3-[(2,2,3,3-四氟丙基)硫基]苯氧基]苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.070)N'-(2,5-二甲基-4-[[3-[(五氟乙基)硫基]苯氧基]苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.071)N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.072)N'-(4-[[3-(二氟甲氧基)苯基]硫基]-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.073)N'-(4-[[3-[(二氟甲基)硫基]苯氧基]-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.074)N'-[5-溴-6-(2,3-二氢-1H-茚-2-基氧基)-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.075)N'-[4-[(4,5-二氯-1,3-噻唑-2-基)氧基]-2,5-二甲基苯基]-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.076)N'-[5-溴-6-[(1R)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.077)N'-[5-溴-6-[(1S)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.078)N'-[5-溴-6-[(顺式-4-异丙基环己基)氧基]-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.079)N'-[5-溴-6-[(反式-4-异丙基环己基)氧基]-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.080)N'-[5-溴-6-[1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.081) Ipfentrifluconazole、(1.082) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.083) 2-[6-(4-溴苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.084) 2-[6-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.085) 3-[2-(1-氯环丙基)-3-(3-氯-2-氟-苯基)-2-羟基-丙基]咪唑-4-甲脒、(1.086) 4-[[6-[rac-(2R)-2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羟基-3-(5-硫酮基-4H-1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲脒、(1.087) N-异丙基-N'-[5-甲氧基-2-甲基-4-(2,2,2-三氟-1-羟基-1-苯基乙基)苯基]-N-甲基亚氨基甲酰胺、(1.088) N'-{5-溴-2-甲基-6-[(1-丙氧基丙-2-基)氧基]吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(1.089) 己唑醇(hexaconazole)、(1.090) 戊菌唑(penconazole)、(1.091) 腈苯唑(fenbuconazole)。

[0291] 2) 呼吸链复合物 I 或 II 的抑制剂, 例如 (2.001) 苯并烯氟菌唑(benzovindiflupyr)、(2.002) 联苯吡菌胺(bixafen)、(2.003) 啉酰菌胺(boscalid)、(2.004) 萎锈灵(carboxin)、(2.005) 氟吡菌酰胺(fluopyram)、(2.006) 氟酰胺(flutolanil)、(2.007) 氟唑菌酰胺(fluxapyroxad)、(2.008) 呋吡菌胺(furametpyr)、(2.009) 噻吩酰菌酮(Isofetamid)、(2.010) 吡唑萘菌胺(isopyrazam) (反式差向异构对映异构体1R,4S,9S)、(2.011) 吡唑萘菌胺(反式差向异构对映异构体1S,4R,9R)、(2.012) 吡唑萘菌胺(反式差向异构外消旋体1RS,4SR,9SR)、(2.013) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构外消旋体1RS,4SR,9RS和反式差向异构外消旋体1RS,4SR,9SR的混合物)、(2.014) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构对映异构体1R,4S,9R)、(2.015) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构对映异构体1S,4R,9S)、(2.016) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构外消旋体1RS,4SR,9RS)、(2.017) 氟唑菌苯胺(penflufen)、(2.018) 吡噻菌胺(penthiopyrad)、(2.019) 氟唑菌酰羟胺

(pydiflumetofen)、(2.020) pyraziflumid、(2.021) 氟唑环菌胺 (sedaxane)、(2.022) 1,3-二甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.023) 1,3-二甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.024) 1,3-二甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.025) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[2'-(三氟甲基)联苯-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.026) 2-氟-6-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)苯甲酰胺、(2.027) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.028) inpyrfluxam、(2.029) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.030) fluindapyr、(2.031) 3-(二氟甲基)-N-[(3R)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.032) 3-(二氟甲基)-N-[(3S)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.033) 5,8-二氟-N-[2-(2-氟-4-{[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]氧基}苯基)乙基]喹唑啉-4-胺、(2.034) N-(2-环戊基-5-氟苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.035) N-(2-叔丁基-5-甲基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.036) N-(2-叔丁基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.037) N-(5-氯-2-乙基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.038) isoflucypram、(2.039) N-[(1R,4S)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-桥亚甲基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.040) N-[(1S,4R)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-桥亚甲基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.041) 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、(2.042) N-[2-氯-6-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.043) N-[3-氯-2-氟-6-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.044) N-[5-氯-2-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.045) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-N-[5-甲基-2-(三氟甲基)苄基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.046) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-氟-6-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.047) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基-5-甲基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.048) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.049) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.050) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(5-氟-2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.051) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-4,5-二甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.052) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-氟苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.053) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.054) N-环丙基-N-(2-环丙基-5-氟苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.055) N-环丙基-N-(2-环丙基-5-甲基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.056) N-环丙基-N-(2-环丙基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.057) pyrapropoyne、(2.058) N-[rac-(1S,2S)-2-(2,4-二氯苯基)环丁基]-2-(三氟甲基)烟酰胺、(2.059) N-[(1S,2S)-2-(2,4-二氯苯基)环丁基]-2-(三氟甲基)烟酰胺。

[0292] 3) 呼吸链复合物III的抑制剂,例如(3.001) 啞啞菌胺 (ametoctradin)、(3.002) 安

美速 (amisulbrom)、(3.003) 腈嘧菌酯 (azoxystrobin)、(3.004) 甲香菌酯 (coumethoxystrobin)、(3.005) 丁香菌酯 (coumoxystrobin)、(3.006) 氰霜唑 (cyazofamid)、(3.007) 醚菌胺 (dimoxystrobin)、(3.008) 烯肟菌酯 (enoxastrobin)、(3.009) 唑菌酮 (famoxadone)、(3.010) 咪唑菌酮 (fenamidone)、(3.011) 氟菌螬酯 (flufenoxystrobin)、(3.012) 氟嘧菌酯 (fluoxastrobin)、(3.013) 醚菌酯 (kresoxim-甲基)、(3.014) 苯氧菌胺 (metominostrobin)、(3.015) 肟醚菌胺 (orysastrobin)、(3.016) 啉氧菌酯 (picoxystrobin)、(3.017) 唑菌胺酯 (pyraclostrobin)、(3.018) 唑胺菌酯 (pyrametostrobin)、(3.019) 唑胺菌酯 (pyraoxystrobin)、(3.020) 肟菌酯 (trifloxystrobin)、(3.021) (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、(3.022) (2E, 3Z)-5-{[1-(4-氯苯基)-1H-吡唑-3-基]氧基}-2-(甲氧基亚氨基)-N,3-二甲基戊-3-烯酰胺、(3.023) (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、(3.024) (2S)-2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺、(3.025) fenpicoxamid、(3.026) mandestrobin、(3.027) N-(3-乙基-3,5,5-三甲基环己基)-3-甲酰胺基-2-羟基苯甲酰胺、(3.028) (2E, 3Z)-5-{[1-(4-氯-2-氟苯基)-1H-吡唑-3-基]氧基}-2-(甲氧基亚氨基)-N,3-二甲基戊-3-烯酰胺、(3.029) {5-[3-(2,4-二甲基苯基)-1H-吡唑-1-基]-2-甲基苄基}氨基甲酸甲酯、(3.030) metyltetraprole、(3.031) florylpicoxamid。

[0293] 4) 有丝分裂和细胞分裂抑制剂,例如(4.001) 多菌灵 (carbendazim)、(4.002) 乙霉威 (diethofencarb)、(4.003) 噻唑菌胺 (ethaboxam)、(4.004) 氟吡菌胺 (fluopicolide)、(4.005) 戊菌隆 (pencycuron)、(4.006) 噻苯咪唑 (thiabendazole)、(4.007) 甲基硫菌灵 (thiophanate-甲基)、(4.008) 苯酰菌胺 (zoxamide)、(4.009) pyridachlometyl、(4.010) 3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基哒嗪、(4.011) 3-氯-5-(6-氯吡啶-3-基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)哒嗪、(4.012) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.013) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.014) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.015) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.016) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.017) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.018) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.019) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.020) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.021) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.022) 4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基哒嗪、(4.023) N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.024) N-(2-溴苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.025) N-(4-氯-2,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.026) fluopimomid。

[0294] 5) 具有多位点活性的化合物,例如(5.001) 波尔多液 (bordeaux mixture)、(5.002) 敌菌丹 (captan)、(5.003) 克菌丹 (captan)、(5.004) 百菌清 (chlorothalonil)、(5.005) 氢氧化铜、(5.006) 环烷酸铜 (copper naphthenate)、(5.007) 氧化铜、(5.008) 氧氯化铜 (copper oxychloride)、(5.009) 硫酸铜(2+) (copper (2+) sulfate)、(5.010) 二噻农

(dithianon)、(5.011)多果定(dodine)、(5.012)灭菌丹(folpet)、(5.013)代森锰锌(mancozeb)、(5.014)代森锰(maneb)、(5.015)代森联(metiram)、(5.016)代森联锌(metiram zinc)、(5.017)喹啉铜(oxine-copper)、(5.018)丙森锌(propineb)、(5.019)硫和硫制剂(包括多硫化钙)、(5.020)福美双(thiram)、(5.021)代森锌(zineb)、(5.022)福美锌(ziram)、(5.023)6-乙基-5,7-二氧化-6,7-二氢-5H-吡咯并[3',4':5,6][1,4]二噻英并[2,3-c][1,2]噻唑-3-甲腈。

[0295] 6) 诱导宿主防御的化合物,例如(6.001)阿拉酸式苯-S-甲基(acibenzolar-S-甲基)、(6.002)异噻菌胺(isotianil)、(6.003)烯丙苯噻唑(probenazole)、(6.004)噻酰菌胺(tiadinil)。

[0296] 7) 氨基酸和/或蛋白质生物合成抑制剂,例如(7.001)噻菌环胺(cyprodinil)、(7.002)春雷霉素(kasugamycin)、(7.003)春雷霉素盐酸盐水合物(kasugamycin盐酸盐hydrate)、(7.004)土霉素(oxytetracycline)、(7.005)噻霉胺(pyrimethanil)、(7.006)3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉。

[0297] 8) ATP生成抑制剂,例如(8.001)硅噻菌胺(silthiofam)。

[0298] 9) 细胞壁合成抑制剂,例如(9.001)苯噻菌胺(benthiavalicarb)、(9.002)烯酰吗啉(dimethomorph)、(9.003)氟吗啉(flumorph)、(9.004)缬霉威(iprovalicarb)、(9.005)双炔酰菌胺(mandipropamid)、(9.006)丁吡吗啉(pyrimorph)、(9.007)缬菌胺(valifenalate)、(9.008)(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、(9.009)(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。

[0299] 10) 脂和膜合成抑制剂,例如(10.001)霜霉威(propamocarb)、(10.002)霜霉威盐酸盐(propamocarb hydrochloride)、(10.003)甲基立枯磷(tolclofos-甲基)。

[0300] 11) 黑色素生物合成抑制剂,例如(11.001)三环唑(tricyclazole)、(11.002)tolprocarb。

[0301] 12) 核酸合成抑制剂,例如(12.001)苯霜灵(benalaxyl)、(12.002)高效苯霜灵(benalaxyl-M)(kiralaxyl)、(12.003)甲霜灵(metalaxyl)、(12.004)高效甲霜灵(metalaxyl-M)(mefenoxam)。

[0302] 13) 信号转导抑制剂,例如(13.001)咯菌腈(fludioxonil)、(13.002)异菌脲(iprodione)、(13.003)腐霉利(procymidone)、(13.004)丙氧喹啉(proquinazid)、(13.005)喹氧灵(quinoxifen)、(13.006)乙烯菌核利(vinclozolin)。

[0303] 14) 用作解偶联剂的化合物,例如(14.001)氟啶胺(fluzinam)、(14.002)消螨多(meptyldinocap)。

[0304] 15) 其他杀真菌剂,其选自(15.001)脱落酸(abscisic acid)、(15.002)苯噻硫氰(benthiazole)、(15.003)bethoxazin、(15.004)卡巴西霉素(capsimycin)、(15.005)香芹酮(carvone)、(15.006)灭螨锰(chinomethionat)、(15.007)硫杂灵(cufraneb)、(15.008)环氟菌胺(cyflufenamid)、(15.009)霜脲氰(cymoxanil)、(15.010)环丙磺酰胺(cyprosulfamide)、(15.011)flutianil、(15.012)三乙磷酸铝(fosetyl-aluminium)、(15.013)乙磷酸钙(fosetyl-calcium)、(15.014)乙磷酸钠(fosetyl-sodium)、(15.015)异硫氰酸甲酯(methyl isothiocyanate)、(15.016)苯菌酮(metrafenone)、(15.017)灭粉霉

素(mildiomycin)、(15.018)游霉素(natamycin)、(15.019)二甲基二硫代氨基甲酸镍(nickel二甲基dithio氨基甲酸酯)、(15.020)酞菌酯(nitrothal-异丙基)、(15.021)oxamocarb、(15.022)Oxathiapiprolin、(15.023)oxyfenthiin、(15.024)五氯苯酚(pentachlorophenol)及盐、(15.025)亚磷酸及其盐、(15.026)霜霉威-乙膦酸盐(propamocarb-fosetylalte)、(15.027)pyriofenone(chlazafenone)、(15.028)tebufloquin、(15.029)叶枯酞(tecloftalam)、(15.030)甲磺菌胺(tolnifanide)、(15.031)1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-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、(15.032)1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-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、(15.033)2-(6-苄基吡啶-2-基)喹唑啉、(15.034)dipymetitrone、(15.035)2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.036)2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.037)2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.038)2-[6-(3-氟-4-甲氧基苯基)-5-甲基吡啶-2-基]喹唑啉、(15.039)2-[(5R)-3-[2-(1-{[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-唑-5-基]-3-氯苯基甲磺酸酯、(15.040)2-[(5S)-3-[2-(1-{[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-唑-5-基]-3-氯苯基甲磺酸酯、(15.041)Ipflufenquin、(15.042)2-{2-氟-6-[(8-氟-2-甲基喹啉-3-基)氧基]苯基}丙-2-醇、(15.043)fluoxapiprolin、(15.044)2-{3-[2-(1-{[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-唑-5-基}苯基甲磺酸酯、(15.045)2-苄基苯酚及盐、(15.046)3-(4,4,5-三氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉、(15.047)quinofumelin、(15.048)4-氨基-5-氟嘧啶-2-醇(互变异构形式:4-氨基-5-氟嘧啶-2(1H)-酮)、(15.049)4-氧代-4-[(2-苄基乙基)氨基]丁酸、(15.050)5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇、(15.051)5-氯-N'-苄基-N'-(丙-2-炔-1-基)噻吩-2-磺酰肼、(15.052)5-氟-2-[(4-氟苄基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.053)5-氟-2-[(4-甲基苄基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.054)9-氟-2,2-二甲基-5-(喹啉-3-基)-2,3-二氢-1,4-苯并氧杂吡庚因、(15.055){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、(15.056)(2Z)-3-氨基-2-氰基-3-苯基丙烯酸乙酯、(15.057)吩嗪-1-甲酸、(15.058)3,4,5-三羟基苯甲酸丙酯、(15.059)喹啉-8-醇、(15.060)喹啉-8-醇硫酸酯(2:1)、(15.061){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}氨基甲酸叔丁酯、(15.062)5-氟-4-亚氨基-3-甲基-1-[(4-甲基苄基)磺酰基]-3,4-二氢嘧啶-2(1H)-酮、(15.063)aminopyrifin、(15.064)(N'-[2-氯-4-(2-氟苯氧基)-5-甲基苄基]-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺)、(15.065)(N'-(2-氯-5-甲基-4-苯氧基苄基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺)、(15.066)(2-{2-[(7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基)氧基]-6-氟苄基}丙-2-醇)、(15.067)(5-溴-1-(5,6-二甲基吡啶-3-基)-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉)、(15.068)(3-(4,4-二氟-5,5-二甲基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]吡啶-7-基)喹啉)、(15.069)(1-(4,5-二甲基-1H-苯并

咪唑-1-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉)、(15.070)8-氟-3-(5-氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹诺酮、(15.071)8-氟-3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹诺酮、(15.072)3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)-8-氟喹啉、(15.073)(N-甲基-N-苄基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺)、(15.074){4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基}氨基甲酸甲酯、(15.075)(N-{4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基}环丙烷甲酰胺)、(15.076)N-甲基-4-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-苯甲酰胺、(15.077)N-[(E)-甲氧基亚氨基甲基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺、(15.078)N-[(Z)-甲氧基亚氨基甲基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺、(15.079)N-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]环丙烷甲酰胺、(15.080)N-(2-氟苄基)-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺、(15.081)2,2-二氟-N-甲基-2-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]乙酰胺、(15.082)N-烯丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]乙酰胺、(15.083)N-[(E)-N-甲氧基-C-甲基-碳亚氨基]-4-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)苯甲酰胺、(15.084)N-[(Z)-N-甲氧基-C-甲基-碳亚氨基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺、(15.085)N-烯丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]-丙酰胺、(15.086)4,4-二甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]-吡咯烷-2-酮、(15.087)N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]-硫代苯甲酰胺、(15.088)5-甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]吡咯烷-2-酮、(15.089)N-((2,3-二氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基)甲基)-3,3,3-三氟-丙酰胺、(15.090)1-甲氧基-1-甲基-3-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]脒、(15.091)1,1-二乙基-3-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]脒、(15.092)N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]丙酰胺、(15.093)N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]环丙烷甲酰胺、(15.094)1-甲氧基-3-甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]脒、(15.095)N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]环丙烷甲酰胺、(15.096)N,2-二甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]丙酰胺、(15.097)N-乙基-2-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]丙酰胺、(15.098)1-甲氧基-3-甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]脒、(15.099)1,3-二甲氧基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]脒、(15.100)3-乙基-1-甲氧基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]脒、(15.101)1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]哌啶-2-酮、(15.102)4,4-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]异噁唑烷-3-酮、(15.103)5,5-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]异噁唑烷-3-酮、(15.104)3,3-二甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]哌啶-2-酮、(15.105)1-[[3-氟-4-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基)甲基]氮杂环庚-2-酮、(15.106)4,4-二甲基-2-[[4-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基)甲基]异噁唑烷-3-酮、(15.107)5,5-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基]甲基]异噁唑烷-3-酮、(15.108)1-{4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基}-1H-吡唑-4-甲酸乙酯、(15.109)N,N-二甲基-1-{4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基}-1H-1,2,4-三唑-3-胺、(15.110)N-

{2,3-二氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基}丁酰胺、(15.111)N-(1-甲基环丙基)-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺、(15.112)N-(2,4-二氟苄基)-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺、(15.113)1-(5,6-二甲基吡啶-3-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉、(15.114)1-(6-(二氟甲基)-5-甲基-吡啶-3-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉、(15.115)1-(5-(氟甲基)-6-甲基-吡啶-3-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉、(15.116)1-(6-(二氟甲基)-5-甲氧基-吡啶-3-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉、(15.117)4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基二甲基氨基甲酸酯、(15.118)N-{4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苄基}丙酰胺、(15.119)3-[2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-1,5-二氢-2,4-苯并二氧杂环庚三烯-6-基甲磺酸酯、(15.120)9-氟-3-[2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-1,5-二氢-2,4-苯并二氧杂环庚三烯-6-基甲磺酸酯、(15.121)3-[2-(1-{[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-1,5-二氢-2,4-苯并二氧杂环庚三烯-6-基甲磺酸酯、(15.122)3-[2-(1-{[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-9-氟-1,5-二氢-2,4-苯并二氧杂环庚三烯-6-基甲磺酸酯、(15.123)1-(6,7-二甲基吡唑并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉、(15.124)8-氟-N-(4,4,4-三氟-2-甲基-1-苯基丁-2-基)喹啉-3-甲酰胺、(15.125)8-氟-N-[(2S)-4,4,4-三氟-2-甲基-1-苯基丁-2-基]喹啉-3-甲酰胺、(15.126)N-(2,4-二甲基-1-苯基戊-2-基)-8-氟喹啉-3-甲酰胺和(15.127)N-[(2S)-2,4-二甲基-1-苯基戊-2-基]-8-氟喹啉-3-甲酰胺。

[0305] 本发明的另一方面涉及一种或多种以下化合物结合物：

[0306] (I.01)+(1.001)、(I.01)+(1.002)、(I.01)+(1.003)、(I.01)+(1.004)、(I.01)+(1.005)、(I.01)+(1.006)、(I.01)+(1.007)、(I.01)+(1.008)、(I.01)+(1.009)、(I.01)+(1.010)、(I.01)+(1.011)、(I.01)+(1.012)、(I.01)+(1.013)、(I.01)+(1.014)、(I.01)+(1.015)、(I.01)+(1.016)、(I.01)+(1.017)、(I.01)+(1.018)、(I.01)+(1.019)、(I.01)+(1.020)、(I.01)+(1.021)、(I.01)+(1.022)、(I.01)+(1.023)、(I.01)+(1.024)、(I.01)+(1.025)、(I.01)+(1.026)、(I.01)+(1.027)、(I.01)+(1.028)、(I.01)+(1.029)、(I.01)+(1.030)、(I.01)+(1.031)、(I.01)+(1.032)、(I.01)+(1.033)、(I.01)+(1.034)、(I.01)+(1.035)、(I.01)+(1.036)、(I.01)+(1.037)、(I.01)+(1.038)、(I.01)+(1.039)、(I.01)+(1.040)、(I.01)+(1.041)、(I.01)+(1.042)、(I.01)+(1.043)、(I.01)+(1.044)、(I.01)+(1.045)、(I.01)+(1.046)、(I.01)+(1.047)、(I.01)+(1.048)、(I.01)+(1.049)、(I.01)+(1.050)、(I.01)+(1.051)、(I.01)+(1.052)、(I.01)+(1.053)、(I.01)+(1.054)、(I.01)+(1.055)、(I.01)+(1.056)、(I.01)+(1.057)、(I.01)+(1.058)、(I.01)+(1.059)、(I.01)+(1.060)、(I.01)+(1.061)、(I.01)+(1.062)、(I.01)+(1.063)、(I.01)+(1.064)、(I.01)+(1.065)、(I.01)+(1.066)、(I.01)+(1.067)、(I.01)+(1.068)、(I.01)+(1.069)、(I.01)+(1.070)、(I.01)+(1.071)、(I.01)+(1.072)、(I.01)+(1.073)、(I.01)+(1.074)、(I.01)+(1.075)、(I.01)+(1.076)、(I.01)+(1.077)、(I.01)+(1.078)、(I.01)+(1.079)、(I.01)+(1.080)、(I.01)+(1.081)、(I.01)+(1.082)、(I.01)+(1.083)、(I.01)+(1.084)、(I.01)+(1.085)、(I.01)+(1.086)、(I.01)+(1.087)、(I.01)+(1.088)、(I.01)+(1.089)、(I.01)+

(1.090)、(I.01)+(1.091)、(I.01)+(2.001)、(I.01)+(2.002)、(I.01)+(2.003)、(I.01)+(2.004)、(I.01)+(2.005)、(I.01)+(2.006)、(I.01)+(2.007)、(I.01)+(2.008)、(I.01)+(2.009)、(I.01)+(2.010)、(I.01)+(2.011)、(I.01)+(2.012)、(I.01)+(2.013)、(I.01)+(2.014)、(I.01)+(2.015)、(I.01)+(2.016)、(I.01)+(2.017)、(I.01)+(2.018)、(I.01)+(2.019)、(I.01)+(2.020)、(I.01)+(2.021)、(I.01)+(2.022)、(I.01)+(2.023)、(I.01)+(2.024)、(I.01)+(2.025)、(I.01)+(2.026)、(I.01)+(2.027)、(I.01)+(2.028)、(I.01)+(2.029)、(I.01)+(2.030)、(I.01)+(2.031)、(I.01)+(2.032)、(I.01)+(2.033)、(I.01)+(2.034)、(I.01)+(2.035)、(I.01)+(2.036)、(I.01)+(2.037)、(I.01)+(2.038)、(I.01)+(2.039)、(I.01)+(2.040)、(I.01)+(2.041)、(I.01)+(2.042)、(I.01)+(2.043)、(I.01)+(2.044)、(I.01)+(2.045)、(I.01)+(2.046)、(I.01)+(2.047)、(I.01)+(2.048)、(I.01)+(2.049)、(I.01)+(2.050)、(I.01)+(2.051)、(I.01)+(2.052)、(I.01)+(2.053)、(I.01)+(2.054)、(I.01)+(2.055)、(I.01)+(2.056)、(I.01)+(2.057)、(I.01)+(2.058)、(I.01)+(2.059)、(I.01)+(3.001)、(I.01)+(3.002)、(I.01)+(3.003)、(I.01)+(3.004)、(I.01)+(3.005)、(I.01)+(3.006)、(I.01)+(3.007)、(I.01)+(3.008)、(I.01)+(3.009)、(I.01)+(3.010)、(I.01)+(3.011)、(I.01)+(3.012)、(I.01)+(3.013)、(I.01)+(3.014)、(I.01)+(3.015)、(I.01)+(3.016)、(I.01)+(3.017)、(I.01)+(3.018)、(I.01)+(3.019)、(I.01)+(3.020)、(I.01)+(3.021)、(I.01)+(3.022)、(I.01)+(3.023)、(I.01)+(3.024)、(I.01)+(3.025)、(I.01)+(3.026)、(I.01)+(3.027)、(I.01)+(3.028)、(I.01)+(3.029)、(I.01)+(3.030)、(I.01)+(3.031)、(I.01)+(4.001)、(I.01)+(4.002)、(I.01)+(4.003)、(I.01)+(4.004)、(I.01)+(4.005)、(I.01)+(4.006)、(I.01)+(4.007)、(I.01)+(4.008)、(I.01)+(4.009)、(I.01)+(4.010)、(I.01)+(4.011)、(I.01)+(4.012)、(I.01)+(4.013)、(I.01)+(4.014)、(I.01)+(4.015)、(I.01)+(4.016)、(I.01)+(4.017)、(I.01)+(4.018)、(I.01)+(4.019)、(I.01)+(4.020)、(I.01)+(4.021)、(I.01)+(4.022)、(I.01)+(4.023)、(I.01)+(4.024)、(I.01)+(4.025)、(I.01)+(4.026)、(I.01)+(5.001)、(I.01)+(5.002)、(I.01)+(5.003)、(I.01)+(5.004)、(I.01)+(5.005)、(I.01)+(5.006)、(I.01)+(5.007)、(I.01)+(5.008)、(I.01)+(5.009)、(I.01)+(5.010)、(I.01)+(5.011)、(I.01)+(5.012)、(I.01)+(5.013)、(I.01)+(5.014)、(I.01)+(5.015)、(I.01)+(5.016)、(I.01)+(5.017)、(I.01)+(5.018)、(I.01)+(5.019)、(I.01)+(5.020)、(I.01)+(5.021)、(I.01)+(5.022)、(I.01)+(5.023)、(I.01)+(6.001)、(I.01)+(6.002)、(I.01)+(6.003)、(I.01)+(6.004)、(I.01)+(7.001)、(I.01)+(7.002)、(I.01)+(7.003)、(I.01)+(7.004)、(I.01)+(7.005)、(I.01)+(7.006)、(I.01)+(8.001)、(I.01)+(9.001)、(I.01)+(9.002)、(I.01)+(9.003)、(I.01)+(9.004)、(I.01)+(9.005)、(I.01)+(9.006)、(I.01)+(9.007)、(I.01)+(9.008)、(I.01)+(9.009)、(I.01)+(10.001)、(I.01)+(10.002)、(I.01)+(10.003)、(I.01)+(11.001)、(I.01)+(11.002)、(I.01)+(12.001)、(I.01)+(12.002)、(I.01)+(12.003)、(I.01)+(12.004)、(I.01)+(13.001)、(I.01)+(13.002)、(I.01)+(13.003)、(I.01)+(13.004)、(I.01)+(13.005)、(I.01)+(13.006)、(I.01)+(14.001)、(I.01)+(14.002)、(I.01)+(15.001)、(I.01)+(15.002)、(I.01)+(15.003)、(I.01)+(15.004)、(I.01)+(15.005)、(I.01)+(15.006)、(I.01)+(15.007)、(I.01)+(15.008)、(I.01)+(15.009)、(I.01)+(15.010)、(I.01)+(15.011)、(I.01)+(15.012)、(I.01)+(15.013)、(I.01)+(15.014)、

(I.01)+(15.015)、(I.01)+(15.016)、(I.01)+(15.017)、(I.01)+(15.018)、(I.01)+(15.019)、(I.01)+(15.020)、(I.01)+(15.021)、(I.01)+(15.022)、(I.01)+(15.023)、(I.01)+(15.024)、(I.01)+(15.025)、(I.01)+(15.026)、(I.01)+(15.027)、(I.01)+(15.028)、(I.01)+(15.029)、(I.01)+(15.030)、(I.01)+(15.031)、(I.01)+(15.032)、(I.01)+(15.033)、(I.01)+(15.034)、(I.01)+(15.035)、(I.01)+(15.036)、(I.01)+(15.037)、(I.01)+(15.038)、(I.01)+(15.039)、(I.01)+(15.040)、(I.01)+(15.041)、(I.01)+(15.042)、(I.01)+(15.043)、(I.01)+(15.044)、(I.01)+(15.045)、(I.01)+(15.046)、(I.01)+(15.047)、(I.01)+(15.048)、(I.01)+(15.049)、(I.01)+(15.050)、(I.01)+(15.051)、(I.01)+(15.052)、(I.01)+(15.053)、(I.01)+(15.054)、(I.01)+(15.055)、(I.01)+(15.056)、(I.01)+(15.057)、(I.01)+(15.058)、(I.01)+(15.059)、(I.01)+(15.060)、(I.01)+(15.061)、(I.01)+(15.062)、(I.01)+(15.063)、(I.01)+(15.064)、(I.01)+(15.065)、(I.01)+15.066)、(I.01)+(15.067)、(I.01)+(15.068)、(I.01)+(15.069)、(I.01)+(15.070)、(I.01)+(15.071)、(I.01)+(15.072)、(I.01)+(15.073)、(I.01)+(15.074)、(I.01)+(15.075)、(I.01)+(15.076)、(I.01)、(I.01)+(15.077)、(I.01)+(15.078)、(I.01)+(15.079)、(I.01)+(15.080)、(I.01)+(15.081)、(I.01)+(15.082)、(I.01)+(15.083)、(I.01)+(15.084)、(I.01)+(15.085)、(I.01)+(15.086)、(I.01)+(15.087)、(I.01)+(15.088)、(I.01)+(15.089)、(I.01)+(15.090)、(I.01)+(15.091)、(I.01)+(15.092)、(I.01)+(15.093)、(I.01)+(15.094)、(I.01)+(15.095)、(I.01)+(15.096)、(I.01)+(15.097)、(I.01)+(15.098)、(I.01)+(15.099)、(I.01)+(15.100)、(I.01)+(15.101)、(I.01)+(15.102)、(I.01)+(15.103)、(I.01)+(15.104)、(I.01)+(15.105)、(I.01)+(15.106)、(I.01)+(15.107)、(I.01)+(15.108)、(I.01)+(15.109)、(I.01)+(15.110)、(I.01)+(15.111)、(I.01)+(15.112)、(I.01)+(15.113)、(I.01)+(15.114)、(I.01)+(15.115)、(I.01)+(15.116)、(I.01)+(15.117)、(I.01)+(15.118)、(I.01)+(15.119)、(I.01)+(15.120)、(I.01)+(15.121)、(I.01)+(15.122)、(I.01)+(15.123)、(I.01)+(15.124)、(I.01)+(15.125)、(I.01)+(15.126)、(I.01)+(15.127)。

[0307] 在这些结合物中,第一种组分为表I.1中所定义的式(I)的化合物(例如,I.01),而第二种组分为在本文中所定义的组1至15中所选择的杀真菌剂。例如,结合物(I.01)+(1.001)对应于包含表I.1中的化合物I.01和环唑醇(1.001)的结合物。

[0308] 在一些其他实施方案中,化合物结合物对应于上述结合物,其中化合物(I.01)被表I.1中所提及的任一化合物所替换。

[0309] 式(I)的化合物和选自组(1)至(15)的杀真菌剂可以100:1至1:100(式(I)的化合物:选自组(1)至(15)的杀真菌剂)或50:1至1:50,或20:1至1:20的重量比存在。重量比范围的其他实例包括95:1至1:95、90:1至1:90、85:1至1:85、80:1至1:80、75:1至1:75、70:1至1:70、65:1至1:65、60:1至1:60、55:1至1:55、45:1至1:45、40:1至1:40、35:1至1:35、30:1至1:30、25:1至1:25、15:1至1:15、10:1至1:10、5:1至1:5、4:1至1:4、3:1至1:3、2:1至1:2。

[0310] 可将本文中所定义的组1至15中所选择的另一杀真菌剂添加至化合物结合物。

[0311] 式(I)的化合物和包含其的组合物可与一种或多种生物防治剂进行结合。

[0312] 可与式(I)的化合物和包含其的组合物结合的生物防治剂的实例为:

[0313] (A) 选自以下的抗菌剂:

[0314] (A1) 细菌,如(A1.1) 枯草芽孢杆菌 (*Bacillus subtilis*),特别是菌株QST713/AQ713(可从Bayer CropScience LP,US以SERENADE OPTI或SERENADE ASO得到,登记号为NRRL B21661且记载于美国专利第6,060,051号中);(A1.2) 解淀粉芽孢杆菌 (*Bacillus amyloliquefaciens*),特别是菌株D747(可从Certis,US以Double NickelTM得到,登记号为FERM BP-8234且记载于美国专利第7,094,592号中);(A1.3) 短小芽孢杆菌 (*Bacillus pumilus*),特别是菌株BU F-33(登记号为NRRL 50185);(A1.4) *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* 菌株FZB24(可从Novozymes,US以**Taegro**[®]得到);(A1.5) 类芽孢杆菌属 (*Paenibacillus* sp.) 菌株,登记号为NRRL B-50972或登记号为NRRL B-67129,且记载于国际专利公开号WO 2016/154297中;以及

[0315] (A2) 真菌,如(A2.1) 出芽短梗霉菌 (*Aureobasidium pullulans*),特别是菌株DSM14940的芽生孢子;(A2.2) 菌株DSM 14941的出芽短梗霉菌芽生孢子;(A2.3) 出芽短梗霉菌,特别是菌株DSM14940和DSM14941的芽生孢子的混合物;

[0316] (B) 选自以下的杀真菌剂:

[0317] (B1) 细菌,例如(B1.1) 枯草芽孢杆菌,特别是菌株QST713/AQ713(可从Bayer CropScience LP,US以SERENADE OPTI或SERENADE ASO得到,登记号NRRL B21661且记载于美国专利第6,060,051号中);(B1.2) 短小芽孢杆菌,特别是菌株QST2808(可从Bayer CropScience LP,US以**SONATA**[®]得到,登记号NRRL B-30087且记载于美国专利第6,245,551号中);(B1.3) 短小芽孢杆菌,特别是菌株GB34(可从Bayer AG,DE以**Yield Shield**[®]得到);(B1.4) 短小芽孢杆菌,特别是菌株BU F-33(登记号NRRL50185);(B1.5) 解淀粉芽孢杆菌,特别是菌株D747(可从Certis,US以Double NickelTM得到,登记号FERM BP-8234且公开于美国专利第7,094,592号中);(B1.6) 枯草芽孢杆菌Y1336(可从中国台湾的Bion-Tech以**BIOBAC**[®] WP得到,在中国台湾以登记号4764、5454、5096和5277登记为生物杀真菌剂);(B1.7) 解淀粉芽孢杆菌菌株MBI 600(可从BASF SE以SUBTILEX得到);(B1.8) 枯草芽孢杆菌菌株GB03(可从Bayer AG,DE以**Kodiak**[®]得到);(B1.9) *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* 菌株FZB24(可从Novozymes Biologicals Inc.,Salem,Virginia或Syngenta Crop Protection,LLC,Greensboro,North Carolina以杀真菌剂**TAEGRO**[®]或**TAEGRO**[®] ECO(EPA登记号70127-5)得到);(B1.10) 蕈状芽孢杆菌 (*Bacillus mycoides*),分离物J(可从Certis USA以BmJ TGAI或WG得到);(B1.11) 藓样芽孢杆菌 (*Bacillus licheniformis*),特别是菌株SB3086(可从Novozymes以EcoGuardTM Biofungicide和Green Releaf得到);(B1.12) 类芽孢杆菌属菌株,登记号为NRRL B-50972或登记号为NRRL B-67129,且记载于国际专利公开号WO 2016/154297中。

[0318] 在一些实施方案中,生物防治剂为枯草芽孢杆菌或解淀粉芽孢杆菌菌株,其产生fengycin或plipastatin型化合物、伊枯草菌素型化合物和/或枯草菌表面活素型化合物。关于背景,参见以下综述文献:Ongena,M.,等人“*Bacillus* Lipopeptides:Versatile Weapons for Plant Disease Biocontrol,”*Trends in Microbiology*,第16卷,第3期,2008年3月,第115-125页。能产生脂肽的芽孢杆菌属菌株包括枯草芽孢杆菌QST713(可从Bayer CropScience LP,US以SERENADE OPTI或SERENADE ASO得到,登记号NRRL B21661且

记载于美国专利第6,060,051号中),解淀粉芽孢杆菌菌株D747(可从Certis,US以Double Nickel™得到,登记号FERM BP-8234且公开于美国专利第7,094,592号中);枯草芽孢杆菌 MBI600(可从Becker Underwood,US以**SUBTILEX**®得到,EPA登记号71840-8);枯草芽孢杆菌Y1336(可从中国台湾的Bion-Tech以**BIOBAC**®WP得到,在中国台湾以登记号4764、5454、5096和5277登记为生物杀真菌剂);解淀粉芽孢杆菌,特别是菌株FZB42(可从ABiTEP,DE以**RHIZOVITAL**®得到);以及Bacillus subtilis var.amyloliquefaciens FZB24(可从Novozymes Biologicals Inc.,Salem,Virginia或Syngenta Crop Protection,LLC, Greensboro,North Carolina以杀真菌剂**TAEGRO**®或**TAEGRO**®ECO(EPA登记号70127-5)得到);和

[0319] (B2) 真菌,例如:(B2.1) 盾壳霉(Coniothyrium minitans),特别是菌株CON/M/91-8(登记号DSM-9660;例如购自Bayer的**Contans**®);(B2.2) 核果梅奇酵母(Metschnikowia fructicola),特别是菌株NRRL Y-30752(例如**Shemer**®);(B2.3) Microsphaeropsis ochracea(例如购自Prophyta的**Microx**®);(B2.5) 木霉属(Trichoderma spp.),包括深绿木霉(Trichoderma atroviride),记载于国际申请号PCT/IT2008/000196中的菌株SC1;(B2.6) Trichoderma harzianum rifai菌株KRL-AG2(也称为菌株T-22,/ATCC 208479,例如购自BioWorks,US的PLANTSHIELD T-22G,**Rootshield**®,和TurfShield);(B2.14) Gliocladium roseum,购自W.F.Stoneman Company LLC的菌株321U;(B2.35) 黄色蠕形霉(Talaromyces flavus),菌株V117b;(B2.36) Trichoderma asperellum,购自Isagro的菌株ICC 012;(B2.37) Trichoderma asperellum,菌株SKT-1(例如购自Kumiai Chemical Industry的ECO-**HOPE**®);(B2.38) 深绿木霉(Trichoderma atroviride),菌株CNCM I-1237(例如购自Agrauxine,FR的**Esquive**®WP);(B2.39) 深绿木霉,菌株号V08/002387;(B2.40) 深绿木霉,菌株NMI号V08/002388;(B2.41) 深绿木霉,菌株NMI号V08/002389;(B2.42) 深绿木霉,菌株NMI号V08/002390;(B2.43) 深绿木霉,菌株LC52(例如由Agrimm Technologies Limited提供的Tenet);(B2.44) 深绿木霉,菌株ATCC 20476(IMI 206040);(B2.45) 深绿木霉,菌株T11(IMI352941/CECT20498);(B2.46);Trichoderma harmatum;(B2.47) 哈茨木霉(Trichoderma harzianum);(B2.48) 哈茨木霉(Trichoderma harzianum rifai) T39(例如购自Makhteshim,US的**Trichodex**®);(B2.49) 哈茨木霉,特别是菌株KD(例如购自Biological Control Products,SA的Trichoplus(由Becker Underwood获得));(B2.50) 哈茨木霉,菌株ITEM 908(例如购自Koppert的Triatum-P);(B2.51) 哈茨木霉,菌株TH35(例如由Mycontrol提供的Root-Pro);(B2.52) 绿木霉(Trichoderma virens)(也称为绿粘帚霉(Gliocladium virens)),特别是菌株GL-21(例如由Certis,US提供的SoilGard 12G);(B2.53) 绿色木霉(Trichoderma viride),菌株TV1(例如由Koppert提供的Triatum-P);(B2.54) 白粉寄生孢(Ampelomyces quisqualis),特别是菌株AQ 10(例如由IntrachemBio Italia提供的**AQ10**®);(B2.56) 出芽短梗霉菌,特别是菌株DSM14940的芽生孢子;(B2.57) 出芽短梗霉菌,特别是菌株DSM 14941的芽生孢子;(B2.58) 出芽短梗霉菌,特别是菌株DSM14940和DSM 14941的芽生孢子的混合物(例如由bio-ferm,CH提供的

Botector®); (B2.64) 枝孢样枝孢霉 (*Cladosporium cladosporioides*), 菌株H39 (由 Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoek提供); (B2.69) 链孢粘帚霉 (*Gliocladium catenulatum*) (同义词:*Clonostachys rosea f. catenulate*) 菌株J1446 (例如由AgBio Inc.提供的**Prestop®**以及例如由Kemira Agro Oy提供的**Primastop®**); (B2.70) 蜡蚧轮枝孢 (*Lecanicillium lecanii*) (先前称为:*Verticillium lecanii*) 菌株KV01的分生孢子 (例如由Koppert/Arysta提供的**Vertalec®**); (B2.71) 蠕形青霉 (*Penicillium vermiculatum*); (B2.72) 异常毕赤酵母 (*Pichia anomala*), 菌株WRL-076 (NRRL Y-30842); (B2.75) 深绿木霉, 菌株SKT-1 (FERM P-16510); (B2.76) 深绿木霉, 菌株SKT-2 (FERM P-16511); (B2.77) 深绿木霉, 菌株SKT-3 (FERM P-17021); (B2.78) 盖姆斯木霉 (*Trichoderma gamsii*) (原名*T. viride*), 菌株ICC080 (IMI CC 392151CABI, 例如由AGROBIOSOL DE MEXICO, S.A. DE C.V.提供的BioDerma); (B2.79) 哈茨木霉, 菌株DB 103 (例如由Dagutat Biolab提供的T-Gro 7456); (B2.80) 多孢木霉 (*Trichoderma polysporum*), 菌株IMI 206039 (例如由BINAB Bio-Innovation AB, Sweden提供的Binab TF WP); (B2.81) *Trichoderma stromaticum* (例如由Ceplac, Brazil提供的Tricovab); (B2.83) *Ulocladium oudemansii*, 特别是菌株HRU3 (例如由Botry-Zen Ltd, NZ提供的Botry-**Zen®**); (B2.84) 黑白轮枝孢 (*Verticillium albo-atrum*) (原名*V. dahliae*), 菌株WCS850 (CBS276.92; 例如由Tree Care Innovations提供的Dutch Trig); (B2.86) 厚垣轮枝孢菌 (*Verticillium chlamydosporium*); (B2.87) 棘孢木霉 (*Trichoderma asperellum*) 菌株ICC 012和盖姆斯木霉菌株ICC 080的混合物 (例如购自Bayer CropScience LP, US称为BIO-TAM™的产品)。

[0320] 可以与式(I)的化合物和包含其的组合物结合的生物防治剂的其他实例为:

[0321] 选自以下的细菌: 蜡状芽孢杆菌 (*Bacillus cereus*), 特别是蜡状芽孢杆菌 (*B. cereus*) 菌株CNCM I-1562和坚强芽孢杆菌 (*Bacillus firmus*), 菌株I-1582 (登记号CNCM I-1582), 枯草芽孢杆菌菌株OST 30002 (登记号NRRL B-50421), 苏云金芽孢杆菌 (*Bacillus thuringiensis*), 特别是苏云金芽孢杆菌以色列亚种 (*B. thuringiensis subspecies israelensis*) (血清型H-14), 菌株AM65-52 (登记号ATCC 1276), 苏云金芽孢杆菌鮎泽亚种 (*B. thuringiensis subsp. aizawai*), 特别是菌株ABTS-1857 (SD-1372), 苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种 (*B. thuringiensis subsp. kurstaki*) 菌株HD-1, 苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种 (*B. thuringiensis subsp. tenebrionis*) 菌株NB 176 (SD-5428), 穿刺芽孢杆菌 (*Pasteuria penetrans*), 巴斯德氏芽菌属 (*Pasteuria spp.*) (肾形线虫 (*Rotylenchulus reniformis* nematode)) -PR3 (登记号ATCC SD-5834), 细黄链霉菌 (*Streptomyces microflavus*) 菌株AQ6121 (=QRD 31.013, NRRL B-50550), 鲜黄链霉菌 (*Streptomyces galbus*) 菌株AQ 6047 (登记号NRRL 30232)。

[0322] 选自以下的真菌和酵母: 球孢白僵菌 (*Beauveria bassiana*), 特别是菌株ATCC 74040; 蜡蚧菌属 (*Lecanicillium spp.*), 特别是菌株HRO LEC 12; 绿僵菌 (*Metarhizium anisopliae*), 特别是菌株F52 (DSM3884或ATCC 90448); 玫烟色拟青霉 (*Paecilomyces fumosoroseus*) (现名: 玫烟色棒束孢 (*Isaria fumosorosea*)), 特别是菌株IFPC 200613或菌株Apopka 97 (登记号ATCC 20874); 和淡紫色拟青霉 (*Paecilomyces lilacinus*), 特别是淡紫色拟青霉菌株251 (AGAL 89/030550);

[0323] 选自以下的病毒:棉褐带卷蛾 (*Adoxophyes orana*) (夏季水果卷叶蛾 (summer fruit tortrix)) 颗粒体病毒 (GV)、苹果蠹蛾 (*Cydia pomonella*) (codling moth) 颗粒体病毒 (GV)、棉铃虫 (*Helicoverpa armigera*) (cotton bollworm) 核多角体病毒 (NPV)、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua*) (beet armyworm) mNPV、草地贪夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*) (fall armyworm) mNPV 和海灰翅夜蛾 (*Spodoptera littoralis*) (非洲棉叶虫 (African cotton leafworm)) NPV。

[0324] 可以作为“接种剂 (inoculant)”加入到植物或植物部位或植物器官并凭借其特定性能促进植物生长和植物健康的细菌和真菌。实例为:土壤杆菌属 (*Agrobacterium* spp.), 茎瘤固氮根瘤菌 (*Azorhizobium caulinodans*), 固氮螺菌属 (*Azospirillum* spp.), 固氮菌属 (*Azotobacter* spp.), 慢生根瘤菌属 (*Bradyrhizobium* spp.), 伯克霍尔德菌属 (*Burkholderia* spp.), 特别是洋葱伯克霍尔德菌 (*Burkholderia cepacia*) (原名为洋葱假单胞菌 (*Pseudomonas cepacia*)), 巨孢囊霉属 (*Gigaspora* spp.) 或 *Gigaspora monosporum*, 球囊霉属 (*Glomus* spp.), 蜡蘑属 (*Laccaria* spp.), 布氏乳杆菌 (*Lactobacillus buchneri*), 类球囊霉属 (*Paraglomus* spp.), *Pisolithus tinctorus*, 假单胞菌属 (*Pseudomonas* spp.), 根瘤菌属 (*Rhizobium* spp.), 特别是三叶草根瘤菌 (*Rhizobium trifolii*), 须腹菌属 (*Rhizopogon* spp.), 硬皮马勃属 (*Scleroderma* spp.), 乳牛肝菌属 (*Suillus* spp.) 和链霉菌属 (*Streptomyces* spp.)。

[0325] 可用作生物防治剂的植物提取物和由微生物形成的产物 (包括蛋白质和次生代谢物) 为:例如,大蒜 (*Allium sativum*)、苦艾 (*Artemisia absinthium*)、印楝素 (azadirachtin)、Biokeeper WP、*Cassia nigricans*、苦皮藤 (*Celastrus angulatus*)、*Chenopodium anthelminticum*、几丁质、*Armour-Zen*、欧洲鳞毛蕨 (*Dryopteris filix-mas*)、问荆 (*Equisetum arvense*)、*Fortune Aza*、*Fungastop*、*Heads Up* (藜麦皂苷提取物 (*Chenopodium quinoa saponin extract*))、除虫菊 (pyrethrum)/除虫菊酯 (pyrethrins)、苏里南苦木 (*Quassia amara*)、栎 (*Quercus*)、皂树 (*Quillaja*)、*Regalia*、“*Requiem*TM 杀昆虫剂”、鱼藤酮 (rotenone)、鱼尼丁 (ryania)/兰尼碱 (ryanodine)、聚合草 (*Symphytum officinale*)、菊蒿 (*Tanacetum vulgare*)、百里酚 (thymol)、*Triact 70*、*TriCon*、*Tropaeolum majus*、大荨麻 (*Urtica dioica*)、藜芦碱 (Veratrin)、白槲寄生 (*Viscum album*)、十字花科 (*Brassicaceae*) 提取物 (尤其是油菜籽粉末或芥末粉末)。

[0326] 可各自地与式 (I) 的化合物和包含其的组合物混合的杀昆虫剂、杀螨剂和杀线虫剂的实例为:

[0327] (1) 乙酰胆碱酯酶 (AChE) 抑制剂, 例如氨基甲酸酯类, 例如棉铃威 (alanycarb)、涕灭威 (aldicarb)、虫威 (bendiocarb)、丙硫克百威 (benfuracarb)、丁酮威 (butocarboxim)、丁酮砜威 (butoxycarboxim)、甲萘威 (carbaryl)、克百威 (carbofuran)、丁硫克百威 (carbosulfan)、乙硫苯威 (ethiofencarb)、仲丁威 (fenobucarb)、伐虫脒 (formetanate)、呋线威 (furathiocarb)、异丙威 (isoprocarb)、甲硫威 (methiocarb)、灭多威 (methomyl)、速灭威 (metolcarb)、杀线威 (oxamyl)、抗蚜威 (pirimicarb)、残杀威 (propoxur)、硫双威 (thiodicarb)、久效威 (thiofanox)、啮蚜威 (triazamate)、混杀威 (trimethacarb)、灭除威 (XMC) 和灭杀威 (xylylcarb), 或有机磷酸酯类, 例如乙酰甲胺磷 (acephate)、甲基吡啶磷 (azamethiphos)、乙基谷硫磷 (azinphos-ethyl)、甲基谷硫磷 (azinphos-methyl)、硫线磷

(cadusafos)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、毒虫畏(chlorfenvinphos)、氯甲硫磷(chlormephos)、甲基毒死蜱(chlorpyrifos-methyl)、蝇毒磷(coumaphos)、杀螟腈(cyanophos)、甲基内吸磷(demeton-S-methyl)、二嗪农(diazinon)、敌敌畏(dichlorvos)/DDVP、百治磷(dicrotophos)、乐果(dimethoate)、甲基毒虫畏(dimethylvinphos)、乙拌磷(disulfoton)、苯硫磷(EPN)、乙硫磷(ethion)、灭线磷(ethoprophos)、伐灭磷(famphur)、苯线磷(fenamiphos)、杀螟硫磷(fenitrothion)、倍硫磷(fenthion)、噻唑膦(fosthiazate)、庚烯磷(heptenophos)、imicyafos、异柳磷(isofenphos)、O-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸异丙酯、异唑磷(isoxathion)、马拉硫磷(malathion)、灭蚜磷(mecarbam)、甲胺磷(methamidophos)、杀扑磷(methidathion)、速灭磷(mevinphos)、久效磷(monocrotophos)、二溴磷(naled)、氧乐果(omethoate)、亚砷磷(oxydemeton-methyl)、甲基对硫磷(parathion-methyl)、稻丰散(phenthoate)、甲拌磷(phorate)、伏杀硫磷(phosalone)、亚胺硫磷(phosmet)、磷胺(phosphamidon)、辛硫磷(phoxim)、甲基嘧啶磷(pirimiphos-methyl)、丙溴磷(profenofos)、胺丙畏(propetamphos)、丙硫磷(prothiofos)、吡唑硫磷(pyraclofos)、哒嗪硫磷(pyridaphenthion)、喹硫磷(quinalphos)、治螟磷(sulfotep)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、双硫磷(temephos)、特丁硫磷(terbufos)、杀虫畏(tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷(thiometon)、三唑磷(triazophos)、敌百虫(triclorfon)和蚜灭磷(vamidothion)。

[0328] (2) GABA门控氯化物通道阻断剂,例如环戊二烯有机氯类,例如氯丹(chlordane)和硫丹(endosulfan),或苯基吡唑类(fiproles),例如乙虫腈(ethiprole)和氟虫腈(fipronil)。

[0329] (3) 钠通道调节剂,例如拟除虫菊酯类(pyrethroids),例如氟丙菊酯(acrinathrin)、丙烯菊酯(allethrin)、d-顺式-反式丙烯菊酯、d-反式丙烯菊酯、联苯菊酯(bifenthrin)、生物丙烯菊酯(bioallethrin)、生物丙烯菊酯S-环戊烯基异构体、生物苜蓿菊酯(bioresmethrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、氟氯氰菊酯(cyfluthrin)、 β -氟氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯(cyhalothrin)、 λ -三氟氯氰菊酯、 γ -三氟氯氰菊酯、氯氰菊酯(cypermethrin)、 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](cyphenothrin[(1R)-trans isomer])、溴氰菊酯(deltamethrin)、右旋烯炔菊酯[(EZ)-(1R)异构体](empenthrin[(EZ)-(1R) isomer])、高氰戊菊酯(esfenvalerate)、醚菊酯(etofenprox)、甲氰菊酯(fenpropathrin)、氰戊菊酯(fenvalerate)、氟氰戊菊酯(flucythrinate)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、 τ -氟胺氰菊酯(tau-fluvalinate)、苜蓿醚(halfenprox)、炔咪菊酯(imiprothrin)、噻恩菊酯(kadethrin)、momfluorothrin、氯菊酯(permethrin)、苯醚菊酯[(1R)-反式异构体](phenothrin[(1R)-trans isomer])、右旋炔丙菊酯(prallethrin)、除虫菊素(pyrethrins)(除虫菊(pyrethrum))、苜蓿菊酯(resmethrin)、氟硅菊酯(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin)、胺菊酯(tetramethrin)、胺菊酯[(EZ)-(1R)异构体](tetramethrin[(EZ)-(1R)-isomer])、四溴菊酯(tralomethrin)和四氟苯菊酯(transfluthrin),或滴滴涕(DDT),或甲氧滴滴涕(methoxychlor)。

[0330] (4) 烟碱能乙酰胆碱受体(nAChR)竞争调节剂,例如新烟碱类(neonicotinoids),例如啉虫脒(acetamiprid)、噻虫胺(clothianidin)、呋虫胺(dinotefuran)、吡虫啉

(imidacloprid)、烯啶虫胺(nitenpyram)、噻虫啉(thiacloprid)和噻虫嗪(thiamethoxam),或烟碱(nicotine),或氟啶虫胺脒(sulfoxaflor),或氟吡呋喃酮(flupyradifurone)。

[0331] (5) 烟碱能乙酰胆碱受体(nAChR)变构调节剂,例如多杀菌素类(spinosyns),例如乙基多杀菌素(spinetoram)和多杀菌素(spinosad)。

[0332] (6) 谷氨酸酯门控氯化物通道(GluCl)变构调节剂,例如阿维菌素类(ivermectins)/米尔倍霉素类(milbemycins),例如阿维菌素(abamectin)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐(emamectin benzoate)、雷皮菌素(lepimectin)和弥拜菌素(milbemectin)。

[0333] (7) 保幼激素模拟物,例如保幼激素类似物,例如烯虫乙酯(hydroprene)、烯虫炔酯(kinoprene)和烯虫酯(methoprene),或苯氧威(fenoxycarb),或吡丙醚(pyriproxyfen)。

[0334] (8) 其他非特异性(多位点)抑制剂,例如烷基卤化物类,例如甲基溴和其他烷基卤化物;或氯化苦(chloropicrine)或硫酰氟(sulphuryl fluoride)或硼砂(borax)或吐酒石(tartar emetic)或异氰酸甲酯生成剂,例如棉隆(diazomet)和威百亩(metam)。

[0335] (9) 弦音器官(Chordotonal Organ)调节剂,例如吡蚜酮(pymetrozine)或氟啶虫酰胺(flonicamide)。

[0336] (10) 螨生长抑制剂,例如四螨嗪(clofentezine)、噻螨酮(hexythiazox)和氟螨嗪(diflovidazin),或乙螨唑(etoxazole)。

[0337] (11) 昆虫肠膜微生物干扰剂,例如苏云金芽孢杆菌以色列亚种(*Bacillus thuringiensis* subspecies *israelensis*)、球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus*)、苏云金芽孢杆菌鮎泽亚种(*Bacillus thuringiensis* subspecies *aizawai*)、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(*Bacillus thuringiensis* subspecies *kurstaki*)、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种(*Bacillus thuringiensis* subspecies *tenebrionis*)和B.t植物蛋白:Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/35Ab1。

[0338] (12) 线粒体ATP合酶抑制剂,例如ATP干扰剂,例如丁醚脲(diafenthiuron),或有机锡化合物,例如三唑锡(azocyclotin)、三环锡(cyhexatin)和苯丁锡(fenbutatin oxide),或炔螨特(propargite),或四氯杀螨砜(tetradifon)。

[0339] (13) 通过间断质子梯度的氧化磷酸化的解偶联剂,例如溴虫脒(chlorfenapyr)、二硝甲酚(DNOC)和氟虫胺(sulfluramid)。

[0340] (14) 烟碱能乙酰胆碱受体通道阻断剂,例如杀虫磺(bensultap)、杀螟丹盐酸盐(cartap hydrochloride)、杀虫环(thiocyclam)和杀虫双(thiosultap-sodium)。

[0341] (15) 0型几丁质生物合成抑制剂,例如双三氟虫脒(bistrifluron)、定虫隆(chlorfluazuron)、二氟脒(diflubenzuron)、氟环脒(flucycloxuron)、氟虫脒(flufenoxuron)、氟铃脒(hexaflumuron)、虱螨脒(lufenuron)、氟酰脒(novaluron)、多氟脒(noviflumuron)、氟苯脒(teflubenzuron)和杀铃脒(triflumuron)。

[0342] (16) 1型几丁质生物合成抑制剂,例如噻嗪酮(buprofezin)。

[0343] (17) 蜕皮干扰剂(尤其是对于双翅目,即双翅类昆虫(dipterans)),例如灭蝇胺(cyromazine)。

[0344] (18) 蜕皮激素受体激动剂,例如环虫酰肼(chromafenozide)、氯虫酰肼

(halofenozide)、甲氧虫酰肼(methoxyfenozide)和虫酰肼(tebufenozide)。

[0345] (19) 章鱼胺受体激动剂,例如双甲脒(amitraz)。

[0346] (20) 线粒体复合物III电子传递抑制剂,例如氟蚁腓(hydramethylnone)或灭螨醌(acequinocyl)或嘧啶酯(flucrypyrim)。

[0347] (21) 线粒体复合物I电子传递抑制剂,例如METI杀螨剂类,例如喹啉酯(fenazaquin)、唑啉酯(fenpyroximate)、嘧啶酯(pyrimidifen)、吡啉灵(pyridaben)、吡啉胺(tebufenpyrad)和唑啉酰胺(tolfenpyrad),或鱼藤酮(rotenone)(鱼藤属(Derris))。

[0348] (22) 电压依赖型钠通道阻断剂,例如茚虫威(indoxacarb)或氰氟虫腓(metaflumizone)。

[0349] (23) 乙酰基辅酶A(CoA)羧化酶抑制剂,例如特窗酸和特特拉姆酸(tetramic acid)衍生物,例如螺螨酯(spirodiclofen)、螺甲螨酯(spiromesifen)和螺虫乙酯(spirotetramat)。

[0350] (24) 线粒体复合物IV电子传递抑制剂,例如磷类,例如磷化铝、磷化钙、磷和磷化锌,或氰化物类,例如氰化钙、氰化钾和氰化钠。

[0351] (25) 线粒体复合物II电子传递抑制剂,例如 β -酮腈衍生物类(beta-ketonitrilederivatives),例如腈吡啉酯(cyenopyrafen)和丁氟螨酯(cyflumetofen)和甲酰苯胺类(carboxanilides),例如pyflubumide。

[0352] (28) 兰尼碱(ryanodine)受体调节剂,例如二酰胺类,例如氯虫苯甲酰胺(chlorantraniliprole)、氰虫酰胺(cyantraniliprole)和氟虫双酰胺(flubendiamide),

[0353] 其他活性化合物,例如啉喃环丙虫酯(Afidopyropen)、阿福拉纳(Afoxolaner)、印楝素(Azadirachtin)、Benclothiaz、苯螨特(Benzoximate)、联苯肼酯(Bifenazate)、溴虫氟苯双酰胺(Broflanilide)、溴螨酯(Bromopropylate)、灭螨猛(Chinomethionat)、氯丙炔菊酯(chloroprallethrin)、冰晶石(Cryolite)、环溴虫酰胺(Cyclaniliprole)、环氧虫啉(Cycloxaprid)、氯氟氰虫酰胺(Cyhalodiamide)、Dicloromezotiaz、三氯杀螨醇(Dicofol)、 ϵ -甲氧苄氟菊酯(Epsilon metofluthrin)、 ϵ -Momfluthrin、Flometoquin、Fluazaindolizine、联氟砒(Fluensulfone)、嘧虫胺(Flufenerim)、氟菌螨酯(Flufenoxystrobin)、丁虫腈(Flufiprole)、Fluhexafon、氟吡菌酰胺(Fluopyram)、氟雷拉纳(Fluralaner)、Fluxametamide、呋喃虫酰肼(Fufenozide)、戊吡虫胍(Guadipyr)、Heptafluthrin、氯噻啉(Imidaclothiz)、异菌脲(Iprodione)、 κ -联苯菊酯(kappa-Bifenthrin)、 κ -七氟菊酯(kappa-Tefluthrin)、Lotilaner、氯氟醚菊酯(Meperfluthrin)、哌虫啉(Paichongding)、啉虫丙醚(Pyridalyl)、Pyrifluquinazon、嘧啶胺(Pyriminostrobin)、Spirobudiclofen、四氟醚菊酯(Tetramethylfluthrin)、氟氰虫酰胺(Tetraniliprole)、四氯虫酰胺(Tetrachlorantraniliprole)、Tiigolaner、Tioxazafen、硫氟脒(Thiofluoximate)、三氟苯嘧啉(Triflumezopyrim)和碘甲烷(iodomethane);其他基于坚强芽孢杆菌(Bacillus firmus)的制剂(I-1582, BioNeem, Votivo),和下列化合物: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(由W02006/043635获知)(CAS 885026-50-6)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吡啶-3,4'-哌啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮(由W02003/106457获知)(CAS 637360-23-7)、2-氯-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]哌啶-4-基}-

4-(三氟甲基)苯基]异烟酰胺(由W02006/003494获知)(CAS 872999-66-1)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-4-羟基-8-甲氧基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(由W0 2010052161获知)(CAS1225292-17-0)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-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(由EP 2647626获知)(CAS-1440516-42-6)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基哌啶-1-基)-5-氟嘧啶(由W02004/099160获知)(CAS 792914-58-0)、PF1364(由JP2010/018586获知)(CAS登记号1204776-60-2)、N-[(2E)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]吡啶-2(1H)-亚基]-2,2,2-三氟乙酰胺(由W02012/029672获知)(CAS 1363400-41-2)、(3E)-3-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-吡啶亚基]-1,1,1-三氟-丙-2-酮(由W02013/144213获知)(CAS1461743-15-6)、N-[3-(苄基氨基甲酰基)-4-氯苯基]-1-甲基-3-(五氟乙基)-4-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-甲酰胺(由W02010/051926获知)(CAS1226889-14-0)、5-溴-4-氯-N-[4-氯-2-甲基-6-(甲基氨基甲酰基)苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)吡唑-3-甲酰胺(由CN103232431获知)(CAS1449220-44-3)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异唑基]-2-甲基-N-(顺式-1-氧化-3-硫杂环丁基)苯甲酰胺、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异唑基]-2-甲基-N-(反式-1-氧化-3-硫杂环丁基)苯甲酰胺和4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异唑基]-2-甲基-N-(顺式-1-氧化-3-硫杂环丁基)苯甲酰胺(由W0 2013/050317 A1获知)(CAS1332628-83-7)、N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亚磺酰基]丙酰胺、(+)-N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亚磺酰基]丙酰胺和(-)-N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亚磺酰基]丙酰胺(由W0 2013/162715 A2、W0 2013/162716 A2、US 2014/0213448A1获知)(CAS1477923-37-7)、5-[[(2E)-3-氯-2-丙烯-1-基]氨基]-1-[2,6-二氯-4-(三氟甲基)苯基]-4-[(三氟甲基)亚磺酰基]-1H-吡唑-3-甲腈(由CN 101337937 A获知)(CAS1105672-77-2)、3-溴-N-[4-氯-2-甲基-6-[(甲基氨基)硫代甲基]苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-甲酰胺,(Liudaibenjiaxuanan,由CN 103109816 A获知)(CAS1232543-85-9);N-[4-氯-2-[[(1,1-二甲基乙基)氨基]羰基]-6-甲基苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(氟甲氧基)-1H-吡唑-5-甲酰胺(由W0 2012/034403A1获知)(CAS1268277-22-0)、N-[2-(5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-甲酰胺(由W0 2011/085575 A1获知)(CAS1233882-22-8)、4-[3-[2,6-二氯-4-[(3,3-二氯-2-丙烯-1-基)氧基]苯氧基]丙氧基]-2-甲氧基-6-(三氟甲基)-嘧啶(由CN 101337940 A获知)(CAS1108184-52-6);(2E)-2-[2-(4-氰基苯基)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]-N-[4-(二氟甲氧基)苯基]胍甲酰胺和2(Z)-2-[2-(4-氰基苯基)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]-N-[4-(二氟甲氧基)苯基]胍甲酰胺(由CN 101715774 A获知)(CAS1232543-85-9);3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基-4-(1H-苯并咪唑-2-基)苯基-环丙烷甲酸酯(由CN 103524422 A获知)(CAS 1542271-46-4);(4aS)-7-氯-2,5-二氢-2-[[(甲氧基羰基)[4-[(三氟甲基)硫基]苯基]氨基]羰基]-茛并[1,2-e][1,3,4]二嗪-4a(3H)-甲酸甲酯(由CN 102391261A获知)(CAS1370358-69-2);6-脱氧-3-O-乙基-2,4-二-O-甲基-1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-五氟乙氧基)苯基]-1H-1,2,4-三唑-3-基]苯基]氨基甲酸酯]- α -L-吡喃甘露糖(由US2014/0275503 A1获知)(CAS1181213-14-8);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-氮杂二环[3.2.1]辛烷(CAS1253850-56-4)、(8-反式)-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-氮杂二环[3.2.1]辛烷(CAS 933798-27-7)、(8-顺式)-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-氮杂二环[3.2.1]辛烷(由WO 2007040280 A1、WO 2007040282 A1获知)(CAS 934001-66-8)、N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)硫基]丙酰胺(由WO 2015/058021 A1、WO 2015/058028 A1获知)(CAS1477919-27-9)和N-[4-(氨基硫代甲基)-2-甲基-6-[(甲基氨基)羰基]苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-甲酰胺(由CN 103265527A获知)(CAS1452877-50-7)、5-(1,3-二氧杂环己烷-2-基)-4-[[4-(三氟甲基)苯基]甲氧基]-嘧啶(由WO 2013/115391 A1获知)(CAS1449021-97-9)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-4-羟基-8-甲氧基-1-甲基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(由WO 2010/066780 A1、WO 2011/151146A1获知)(CAS1229023-34-0)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-1-甲基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-2,4-二酮(由WO 2014/187846A1获知)(CAS1638765-58-8)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-1-甲基-2-氧代-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基-碳酸乙酯(由WO 2010/066780 A1、WO 2011151146 A1获知)(CAS 1229023-00-0)、N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2(1H)-亚吡啶基]-2,2,2-三氟乙酰胺(由DE 3639877 A1、WO 2012029672 A1获知)(CAS 1363400-41-2)、[N(E)]-N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2(1H)-亚吡啶基]-2,2,2-三氟乙酰胺(由WO 2016005276 A1获知)(CAS 1689566-03-7)、[N(Z)]-N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2(1H)-亚吡啶基]-2,2,2-三氟乙酰胺(CAS1702305-40-5)、3-内-3-[2-丙氧基-4-(三氟甲基)苯氧基]-9-[[5-(三氟甲基)-2-吡啶基]氧基]-9-氮杂二环[3.3.1]壬烷(由WO 2011/105506 A1、WO 2016/133011 A1获知)(CAS 1332838-17-1)。

[0354] 可以与式(I)的化合物和包含其的组合物混合的安全剂的实例为例如解草啉(benoxacor)、解毒啉(cloquintocet(-mexyl))、解草胺腈(cyometrinil)、环丙磺酰胺(cyprosulfamide)、二氯丙烯胺(dichlormid)、解草啉(fenclorazole(-ethyl))、解草啉(fenclorim)、解草胺(flurazole)、氟草肟(fluxofenim)、解草啉(furilazole)、双苯啉酸(isoxadifen(-ethyl))、吡啉解草酯(mefenpyr(-diethyl))、萘二甲酸酐(naphthalic anhydride)、解草腈(oxabetrinil)、2-甲氧基-N-({4-[(甲基氨基甲酰基)氨基]苯基}磺酰基)苯甲酰胺(CAS 129531-12-0)、4-(二氯乙酰基)-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷(CAS 71526-07-3)、2,2,5-三甲基-3-(二氯乙酰基)-1,3-唑烷(CAS 52836-31-4)。

[0355] 可以与式(I)的化合物和包含其的组合物混合的除草剂的实例为：

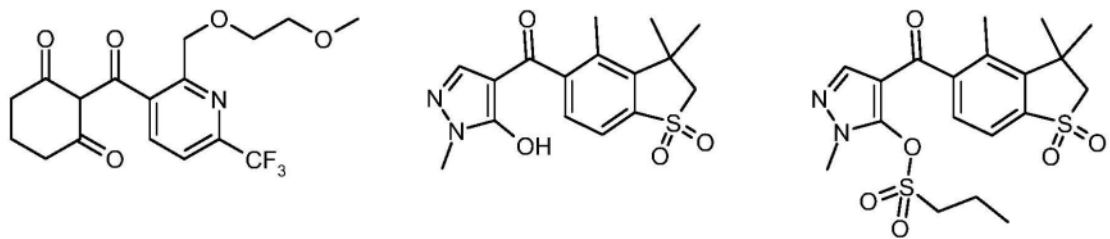
[0356] 乙草胺(acetochlor)、三氟羧草醚(acifluorfen)、三氟羧草醚钠盐(acifluorfen-sodium)、苯草醚(aclonifen)、甲草胺(alachlor)、二丙烯草胺(allidochlor)、禾草灭(alloxydim)、禾草灭钠盐(alloxydim-sodium)、莠灭净(ametryn)、氨基草酮(amicarbazone)、先甲草胺(amidochlor)、酰嘧磺隆(amidosulfuron)、4-氨基-3-氯-6-(4-氯-2-氟-3-甲基苯基)-5-氟吡啶-2-甲酸、环丙嘧啶酸(aminocyclopyrachlor)、环丙嘧啶酸钾盐(aminocyclopyrachlor-potassium)、环丙嘧啶酸甲酯(aminocyclopyrachlor-methyl)、氯氨吡啶酸(aminopyralid)、杀草强(amitrole)、氨基磺酸铵、莎稗磷(anilofos)、磺草灵(asulam)、莠去津(atrazine)、啉啉草酮(azafenidin)、四啉啉磺隆(azimsulfuron)、氟丁酰草胺(beflubutamid)、草除灵(benazolin)、草除灵乙酯(benazolin-ethyl)、乙丁氟灵(benfluralin)、呋草黄(benfuresate)、苄嘧磺隆

(bensulfuron)、苜嘧磺隆甲酯(bensulfuron-methyl)、地散磷(bensulide)、灭草松(bentazone)、双环磺草酮(benzobicyclon)、吡草酮(benzofenap)、氟吡草酮(bicyclopyron)、甲羧除草醚(bifenox)、双丙氨膦(bialaphos)、双丙氨膦钠盐(bilanafos-sodium)、双草醚(bispyribac)、双草醚钠盐(bispyribac-sodium)、除草定(bromacil)、溴丁酰草胺(bromobutide)、溴酚肟(bromofenoxim)、溴苯腈(bromoxynil)、溴苯腈丁酸盐(bromoxynil-butyrate)、溴苯腈钾盐(bromoxynil-potassium)、溴苯腈庚酸盐(bromoxynil-heptanoate)和溴苯腈辛酸盐(bromoxynil-octanoate)、羧草酮(busoxinone)、丁草胺(butachlor)、氟丙嘧草酯(butafenacil)、抑草磷(butamifos)、丁烯草胺(butenachlor)、仲丁灵(butralin)、丁氧环酮(butroxydim)、丁草敌(butylate)、唑草胺(cafenstrole)、双酰草胺(carbetamide)、氟唑草酮(carfentrazone)、氟唑草酮乙酯(carfentrazone-ethyl)、草灭畏(chloramben)、氯溴隆(chlorbromuron)、伐草克(chlorfenac)、伐草克钠盐(chlorfenac-sodium)、燕麦酯(chlorfenprop)、氯苄素(chlorflurenol)、氯苄素甲酯(chlorflurenol-methyl)、氯草敏(chloridazon)、氯嘧磺隆(chlorimuron)、氯嘧磺隆乙酯(chlorimuron-ethyl)、氯酞酰亚胺(chlorophthalim)、绿麦隆(chlorotoluron)、氯酞酸甲酯(chlorthal-dimethyl)、氯磺隆(chlorsulfuron)、吡啶酮(cinidon)、吡啶酮草酯(cinidon-ethyl)、环庚草醚(cinmethylin)、醚磺隆(cinosulfuron)、氯酰草膦(clacyfos)、烯草酮(clethodim)、炔草酸(clodinafop)、炔草酯(clodinafop-propargyl)、异草松(clomazone)、氯甲酰草胺(clomeprop)、二氯吡啶酸(clopyralid)、氯酯磺草胺酸(cloransulam)、氯酯磺草胺(cloransulam-methyl)、苜草隆(cumyluron)、氨基氰(cyanamide)、氰草津(cyanazine)、环草敌(cycloate)、cyclopyrimorate、环胺磺隆(cyclosulfamuron)、噻草酮(cycloxydim)、cyhalofop、氰氟草酯(cyhalofop-butyl)、环丙津(cyprazine)、2,4-D、2,4-D-丁氧基乙基酯(2,4-D-butoyl)、2,4-D-丁基酯、2,4-D-二甲基铵、2,4-D-二醇胺、2,4-D-乙基酯、2,4-D-2-乙基己基酯、2,4-D-异丁基酯、2,4-D-异辛基酯、2,4-D-异丙基铵、2,4-D-钾、2,4-D-三异丙醇铵和2,4-D-三乙醇胺(2,4-D-trolamine)、2,4-DB、2,4-DB-丁基酯、2,4-DB-二甲基铵、2,4-DB-异辛基酯、2,4-DB-钾和2,4-DB-钠、杀草隆(daimuron(dymron))、茅草枯(dalapon)、棉隆(dazomet)、正癸醇、甜菜安(desmedipham)、detosyl-pyrazolate(DTP)、麦草畏(dicamba)、敌草腈(dichlobenil)、2-(2,4-二氯苄基)-4,4-二甲基-1,2-唑烷-3-酮、2-(2,5-二氯苄基)-4,4-二甲基-1,2-唑烷-3-酮、2,4-滴丙酸(dichlorprop)、精2,4-滴丙酸(dichlorprop-P)、二氯苯氧基丙酸(diclofop)、禾草灵(diclofop-methyl)、精禾草灵(diclofop-P-methyl)、双氯磺草胺(diclosulam)、野燕枯(difenzoquat)、吡氟酰草胺(diflufenican)、二氟吡隆(diflufenzopyr)、二氟吡隆钠(diflufenzopyr-sodium)、唑隆(dimefuron)、哌草丹(dimepiperate)、二甲草胺(dimethachlor)、异戊乙净(dimethametryn)、二甲吩草胺(dimethenamid)、精二甲吩草胺(dimethenamid-P)、dimetrasulfuron、氨基氟灵(dinitramine)、特乐酚(dinoterb)、双苯酰草胺(diphenamid)、敌草快(diquat)、二溴敌草快(diquat-dibromide)、氟硫草定(dithiopyr)、敌草隆(diuron)、DNOC、茵多酸(endothal)、EPTC、戊草丹(esprocarb)、乙丁烯氟灵(ethalfluralin)、胺苯磺隆(ethametsulfuron)、甲基胺苯磺隆(ethametsulfuron-methyl)、乙嗞草酮(ethiozin)、乙氧呋草黄(ethofumesate)、氟乳醚(ethoxyfen)、氟乳醚乙酯(ethoxyfen-ethyl)、乙氧嘧磺

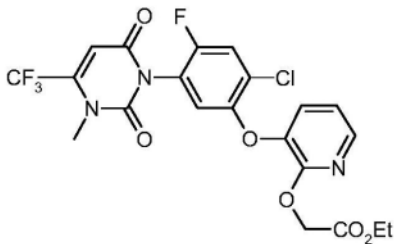
隆 (ethoxysulfuron)、乙氧苯草胺 (etobenzanid)、F-9600、F-5231, 即N-[2-氯-4-氟-5-[4-(3-氟丙基)-5-氧代-4,5-二氢-1H-四唑-1-基]苯基]乙磺酰胺, F-7967, 即3-[7-氯-5-氟-2-(三氟甲基)-1H-苯并咪唑-4-基]-1-甲基-6-(三氟甲基)嘧啶-2,4(1H,3H)-二酮、唑禾草灵 (fenoxaprop)、精唑禾草灵 (fenoxaprop-P)、唑禾草灵乙酯 (fenoxaprop-ethyl)、精唑禾草灵乙酯 (fenoxaprop-P-ethyl)、芬诺杀磺隆 (fenoxasulfone)、fenquinotriene、四唑酰草胺 (fentrazamide)、麦草氟 (flamprop)、高效麦草氟异丙酯 (flamprop-M-isopropyl)、高效麦草氟甲酯 (flamprop-M-methyl)、啶嘧磺隆 (flazasulfuron)、双氟磺草胺 (florasulam)、吡氟禾草灵 (fluazifop)、精吡氟禾草灵 (fluazifop-P)、吡氟禾草灵丁酯 (fluazifop-butyl)、精吡氟禾草灵丁酯 (fluazifop-P-butyl)、氟酮磺隆 (flucarbazone)、氟酮磺隆钠盐 (flucarbazone-sodium)、氟吡磺隆 (flucetosulfuron)、氯乙氟灵 (fluchloralin)、氟噻草胺 (flufenacet)、flufenpyr、氟吡嗪草酯 (flufenpyr-ethyl)、唑嘧磺草胺 (flumetsulam)、氟烯草酸 (flumiclorac)、氟烯草酸戊酯 (flumiclorac-pentyl)、丙炔氟草胺 (flumioxazin)、氟草隆 (fluometuron)、9-羟基苄甲酸 (flurenol)、苄丁酯 (flurenol-butyl)、苄二甲基铵 (flurenol-dimethylammonium)、苄甲酯 (flurenol-methyl)、乙羧氟草醚 (fluoroglycofen)、乙羧氟草醚乙酯 (fluoroglycofen-ethyl)、四氟丙酸 (flupropanate)、氟啶嘧磺隆 (flupyrsulfuron)、氟啶嘧磺隆甲酯钠盐 (flupyrsulfuron-methyl-sodium)、氟啶草酮 (fluridone)、氟咯草酮 (flurochloridone)、氯氟吡氧乙酸 (fluroxypyr)、氯氟吡氧乙酸-甲基庚酯 (fluroxypyr-meptyl)、呋草酮 (flurtamone)、噻草酸 (fluthiacet)、噻草酸甲酯 (fluthiacet-methyl)、氟磺胺草醚 (fomesafen)、氟磺胺草醚钠盐 (fomesafen-sodium)、甲酰氨磺隆 (foramsulfuron)、杀木膦 (fosamine)、草铵膦 (glufosinate)、草铵膦铵盐 (glufosinate-ammonium)、精草铵膦钠盐 (glufosinate-P-sodium)、精草铵膦铵盐 (glufosinate-P-ammonium)、精草铵膦钠盐 (glufosinate-P-sodium)、草甘膦 (glyphosate)、草甘膦铵 (glyphosate-ammonium)、草甘膦异丙基铵 (glyphosate-isopropylammonium)、草甘膦二胺 (glyphosate-diammonium)、草甘膦二甲基铵 (glyphosate-dimethylammonium)、草甘膦钾 (glyphosate-potassium)、草甘膦钠盐 (glyphosate-sodium)、草甘膦三甲基铊盐 (glyphosate-trimesium)、H-9201, 即0-(2,4-二甲基-6-硝基苯基)0-乙基异丙基硫代磷酰胺酯 (0-(2,4-dimethyl-6-nitrophenyl)0-ethyl isopropylphosphoramidothioate)、氟氯吡啶酸 (halauxifen)、氟氯吡啶酯 (halauxifen-methyl)、氟硝磺酰胺 (halosafen)、氯吡嘧磺隆 (halosulfuron)、氯吡嘧磺隆甲酯 (halosulfuron-methyl)、氟吡禾灵 (haloxyfop)、精氟吡禾灵 (haloxyfop-P)、氟吡禾灵乙氧基乙酯 (haloxyfop-ethoxyethyl)、精氟吡禾灵乙氧基乙酯 (haloxyfop-P-ethoxyethyl)、氟吡禾灵甲酯 (haloxyfop-methyl)、精氟吡禾灵甲酯 (haloxyfop-P-methyl)、环嗪酮 (hexazinone)、HW-02, 即乙基-(2,4-二氯苯氧基)乙酸1-(二甲氧基磷酰基)酯、咪草酸 (imazamethabenz)、咪草酸甲酯 (imazamethabenz-methyl)、甲氧咪草烟 (imazamox)、甲氧咪草烟铵盐 (imazamox-ammonium)、甲咪唑烟酸 (imazapic)、甲咪唑烟酸铵盐 (imazapic-ammonium)、咪唑烟酸 (imazapyr)、咪唑烟酸异丙铵 (imazapyr-isopropylammonium)、咪唑喹啉酸 (imazaquin)、咪唑喹啉酸铵 (imazaquin-ammonium)、咪唑乙烟酸 (imazethapyr)、咪唑乙烟酸亚胺 (imazethapyr-immonium)、唑嘧磺隆 (imazosulfuron)、茚草酮 (indanofan)、茚噻氟草胺 (indaziflam)、碘甲磺隆

(iodosulfuron)、碘甲磺隆钠盐(iodosulfuron-methyl-sodium)、碘苯腈(ioxynil)、碘苯腈辛酸酯(ioxynil-octanoate)、碘苯腈钾(ioxynil-potassium)和碘苯腈钠(ioxynil-sodium)、卤苯胺唑(ipfencarbazon)、异丙隆(isoproturon)、异隆(isouron)、异酰草胺(isoxaben)、异唑草酮(isoxaflutole)、特胺灵(karbutilate)、KUH-043,即3-([5-(二氟甲基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-基]甲基)磺酰基)-5,5-二甲基-4,5-二氢-1,2-唑、ketospiradox、乳氟禾草灵(lactofen)、环草定(lenacil)、利谷隆(linuron)、MCPA、MCPA-丁氧基乙基酯(MCPA-butotyl)、MCPA-二甲基铵、MCPA-2-乙基己酯、MCPA-异丙基铵、MCPA-钾、MCPA-钠、MCPB、MCPB-甲酯、MCPB-乙酯、MCPB-钠、2-甲-4-氯丙酸(mecoprop)、2-甲-4-氯丙酸钠(mecoprop-sodium)、2-甲-4-氯丙酸丁氧基乙基酯(mecoprop-butotyl)、精2-甲-4-氯丙酸(mecoprop-P)、精2-甲-4-氯丙酸丁氧基乙基酯(mecoprop-P-butotyl)、精2-甲-4-氯丙酸二甲基铵(mecoprop-P-dimethylammonium)、精-2-甲-4-氯丙酸-2-乙基己酯(mecoprop-P-2-ethylhexyl)、精-2-甲-4-氯丙酸钾(mecoprop-P-potassium)、苯噻酰草胺(mefenacet)、氯磺酰草胺(mefluidide)、二磺隆(mesosulfuron)、甲磺胺磺隆(mesosulfuron-methyl)、甲基磺草酮(mesotrione)、甲基苯噻隆(methabenzthiazuron)、威百亩(metam)、唑酰草胺(metamifop)、苯嗪草酮(metamitron)、吡唑草胺(metazachlor)、双醚氯吡嘧磺隆(metazosulfuron)、甲基苯噻隆(methabenzthiazuron)、甲硫嘧磺隆(methiopyrsulfuron)、methiozolin、甲基异硫氰酸酯、溴谷隆(metobromuron)、异丙甲草胺(metolachlor)、精异丙甲草胺(S-metolachlor)、磺草唑胺(metosulam)、甲氧隆(metoxuron)、嗪草酮(metribuzin)、磺隆(metsulfuron)、甲磺隆(metsulfuron-methyl)、禾草敌(molinate)、绿谷隆(monolinuron)、单嘧磺隆(monosulfuron)、单嘧磺酯(monosulfuron-ester)、MT-5950,即N-[3-氯-4-异丙基苯基]-2-甲基戊酰胺、NGGC-011、敌草胺(napropamide)、NC-310,即[5-苄氧基-1-甲基-1H-吡唑-4-基](2,4-二氯苯基)甲酮、草不隆(neburon)、烟嘧磺隆(nicosulfuron)、壬酸(pelargonic acid)、氟草敏(norflurazon)、油酸(脂肪酸)、坪草丹(orbencarb)、嘧苯胺磺隆(orthosulfamuron)、氨磺乐灵(oryzalin)、丙炔草酮(oxadiargyl)、草酮(oxadiazon)、环氧嘧磺隆(oxasulfuron)、嗪草酮(oxaziclomefon)、乙氧氟草醚(oxyfluorfen)、百草枯(paraquat)、二氯百草枯(paraquat dichloride)、克草猛(pebulate)、二甲戊灵(pendimethalin)、五氟磺草胺(penoxsulam)、五氯苯酚、环戊草酮(pentoxazone)、烯草胺(pethoxamid)、矿物油、苯敌草(phenmedipham)、氨氯吡啶酸(picloram)、氟吡酰草胺(picolinafen)、唑啉草酯(pinoxaden)、哌草磷(piperophos)、丙草胺(pretilachlor)、氟嘧磺隆(primisulfuron)、甲基氟嘧磺隆(primisulfuron-methyl)、氨氟乐灵(prodiamine)、环苯草酮(profoxydim)、扑灭通(prometon)、扑草净(prometryn)、毒草胺(propachlor)、敌稗(propanil)、[0357] 草酸(propaquizafop)、扑灭津(propazine)、苯胺灵(propham)、异丙草胺(propisochlor)、丙苯磺隆(propoxycarbazon)、丙苯磺隆钠盐(propoxycarbazon-sodium)、丙嗪嘧磺隆(propyrisulfuron)、炔苯酰草胺(propyzamide)、苄草丹(prosulfocarb)、氟磺隆(prosulfuron)、双唑草腈(pyraclonil)、pyraflufen,吡草醚(pyraflufen-ethyl)、磺酰草吡唑(pyrasulfotole)、吡唑特(pyrazolynate(pyrazolate))、吡嘧磺隆(pyrazosulfuron)、吡嘧磺隆乙酯(pyrazosulfuron-ethyl)、苄草唑(pyrazoxyfen)、pyribambenz、异丙酯草醚(pyribambenz-isopropyl)、丙酯草醚

(pyribambenz-propyl)、嘧啶肟草醚(pyribenzoxim)、稗草丹(pyributicarb)、pyridafol、吡草特(pyridate)、环酯草醚(pyriftalid)、pyriminobac、嘧草醚(pyriminobac-methyl)、pyrimisulfan、pyrithiobac、嘧草硫醚(pyrithiobac-sodium)、砜吡草唑(pyroxasulfone)、甲氧磺草胺(pyroxulam)、二氯喹啉酸(quinclorac)、氯甲喹啉酸(quinmerac)、灭藻醌(quinoclamine)、喹禾灵(quizalofop)、喹禾灵乙酯(quizalofop-ethyl)、精喹禾灵(quizalofop-P)、精喹禾灵乙酯(quizalofop-P-ethyl)、喹禾糠酯(quizalofop-P-tefuryl)、砜嘧磺隆(rimsulfuron)、苯嘧磺草胺(saflufenacil)、烯禾啉(sethoxydim)、环草隆(siduron)、西玛津(simazine)、西草净(simetryn)、SL-261、磺草酮(sulcotrion)、甲磺草胺(sulfentrazone)、甲嘧磺隆(sulfometuron)、甲嘧磺隆甲酯(sulfometuron-methyl)、磺酰磺隆(sulfosulfuron)、SYN-523、SYP-249,即1-乙氧基-3-甲基-1-氧代丁-3-烯-2-基5-[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]-2-硝基苯甲酸酯,SYP-300,即1-[7-氟-3-氧代-4-(丙-2-炔-1-基)-3,4-二氢-2H-1,4-苯并噻-6-基]-3-丙基-2-硫代咪唑烷-4,5-二酮、2,3,6-TBA、TCA(三氯乙酸)、TCA-钠、丁噻隆(tebuthiuron)、特糠酯酮(tefuryltrione)、环磺酮(tembotrione)、吡喃草酮(tepraloxym)、特草定(terbacil)、特草灵(terbucarb)、甲氧去草净(terbumeton)、特丁津(terbuthylazin)、特丁净(terbutryn)、噻吩草胺(thenylchlor)、噻唑烟酸(thiazopyr)、thiencarbazone、噻酮磺隆(thiencarbazone-methyl)、噻吩磺隆(thifensulfuron)、噻吩磺隆甲酯(thifensulfuron-methyl)、禾草丹(thiobencarb)、tiafenacil、tolpyralate、苯吡唑草酮(topramezone)、三甲苯草酮(tralkoxydim)、氟酮磺草胺(triafamone)、野燕畏(tri-allate)、醚苯磺隆(triasulfuron)、三嗪氟草胺(triaziflam)、苯磺隆母酸(tribenuron)、苯磺隆甲酯(tribenuron-methyl)、三氯吡氧乙酸(triclopyr)、草达津(trietazine)、三氟啶磺隆(trifloxysulfuron)、三氟啶磺隆钠盐(trifloxysulfuron-sodium)、trifludimoxazin、氟乐灵(trifluralin)、氟胺磺隆(triflusulfuron)、氟胺磺隆甲酯(triflusulfuron-methyl)、三氟甲磺隆(tritosulfuron)、硫酸脲(urea sulfate)、灭草敌(vernolate)、XDE-848、ZJ-0862,即3,4-二氯-N-{2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧基]苄基}苯胺,以及以下化合物:



[0358]



[0359] 植物生长调节剂的实例为:

[0360] 阿拉酸式苯(acibenzolar)、阿拉酸式苯-S-甲基(acibenzolar-S-methyl)、5-氨

基乙酰丙酸(5-氨基levolinic acid)、环丙嘧啶醇(ancymidol)、6-苄基氨基嘌呤(6-苄基aminopurine)、芸苔素内酯(Brassinolid)、儿茶酸(catechine)、矮壮素(chlormequat chloride)、调果酸(cloprop)、环丙酰胺酸(cyclanilide)、3-(环丙-1-烯基)丙酸、丁酰肼(daminozide)、棉隆(dazomet)、正癸醇、调吡酸(dikegulac)、调吡酸钠(dikegulac-sodium)、茵多酸(endothal)、茵多酸二钾(endothal-dipotassium)、茵多酸二钠(endothal-disodium)和茵多酸单(N,N-二甲基烷基铵)、乙烯利(ethephon)、氟节胺(flumetralin)、9-羟基茚甲酸(flurenol)、茚丁酯(flurenol-butyl)、咪嘧啉(flurprimidol)、氯吡脲(forchlorfenuron)、赤霉酸(gibberellic acid)、抗倒胺(inabenfide)、吲哚-3-乙酸(indol-3-acetic acid(IAA))、4-吲哚-3-基丁酸、稻瘟灵(isoprothiolane)、烯丙苯噻唑(probenazole)、茉莉酸(jasmonic acid)、马来酸酰肼(maleic hydrazide)、甲哌啶(mepiquat chloride)、1-甲基环丙烯、茉莉酸甲基酯(methyl jasmonate)、2-(1-萘基)乙酰胺、1-萘基乙酸、2-萘氧基乙酸、硝基苯酚盐混合物(nitrophenolate mixture)、多效唑(paclobutrazol)、N-(2-苯基乙基)- β -氨基丙酸、N-苯基邻氨甲酰苯甲酸(N-phenylphthalamic acid)、调环酸(prohexadione)、调环酸钙(prohexadione-calcium)、茉莉酮(prohydrojasmane)、水杨酸、独角金内酯(strigolactone)、四氯硝基苯(tecnazene)、噻苯隆(thidiazuron)、三十烷醇(triacontanol)、trinexapac、抗倒酯(trinexapac-ethyl)、tsitodef、烯效唑(uniconazole)、精烯效唑(uniconazole-P)。

[0361] 方法和用途

[0362] 式(I)的化合物和包含其的组合物具有有效的杀微生物活性。它们可用于防治不想要的微生物,例如不想要的真菌和细菌。它们可特别用于作物保护(它们防治引起植物病害的微生物)或用于保护下文详述的材料(如,工业材料、木材、储存商品)。更具体而言,式(I)的化合物和包含其的组合物可用于保护种子、发芽的种子、新发幼苗、植物、植物部位、果实、收获的物品和/或植物生长的土壤免于不想要的微生物的侵害。

[0363] 本文中使用的防治(control或controlling)涵盖保护性、治疗性和根除性处理不想要的微生物。不想要的微生物可以是病原性细菌、病原性病毒、病原性卵菌或病原性真菌,更具体地为植物病原性细菌、植物病原性病毒、植物病原性卵菌或植物病原性真菌。如下文详述,这些植物病原性微生物是广谱植物病害的病原体。

[0364] 更具体地,式(I)的化合物和包含其的组合物可用作杀真菌剂。就本说明书的目的而言,术语“杀真菌剂”是指这样的化合物或组合物,其可在作物保护中使用以防治不想要的真菌,例如根肿菌、壶菌、接合菌、子囊菌、担子菌和半知菌和/或用于防治卵菌,更优选防治担子菌(引起锈病)。

[0365] 因此,本发明还涉及一种防治不想要的微生物,例如植物病原性真菌、卵菌和细菌的方法,其包括以下步骤:将至少一种式(I)的化合物或至少一种包含其的组合物施用于微生物和/或其生境(施用至植物、植物部位、种子、果实或植物生长的土壤)。

[0366] 通常,在将本发明的化合物和组合物用在防治植物病原性真菌和/或植物病原性卵菌的治疗性或保护性方法中时,将它们以有效且与植物相容的量施用于植物、植物部位、果实、种子或植物生长的土壤或基质。可用于栽培植物的合适的基质包括无机基质,例如矿棉,尤其是石棉、珍珠岩、砂土或砾石;有机基质,例如泥炭、松树皮或锯末;以及基于石油的

基质,例如聚合物泡沫或塑料珠。有效且与植物相容的量是指这样的量,其足以防治或摧毁农田上存在或易于出现的真菌,并且不会引起所述作物产生任何明显的植物毒性症状。该量可以在较大范围内变化,这取决于要防治的真菌、作物类型、作物生长阶段、气候条件以及所使用的本发明的各个化合物或组合物。该量可以通过在本领域技术人员能力范围内的系统性田间试验确定。

[0367] 植物和植物部位

[0368] 式(I)的化合物和包含其的组合物可以施用至任何植物或植物部位。

[0369] 植物意指所有的植物和植物种群,例如想要和不想要的野生植物或作物植物(包括天然存在的作物植物)。作物植物是可以可以通过常规育种和优化法或通过生物技术和基因工程方法或这些方法的结合而获得的植物,包括遗传修饰植物(GMO或转基因植物)以及受或不受植物育种权(plant breeders' rights)保护的植物栽培种。

[0370] 植物部位应当理解为意指植物的地上和地下的所有部位和器官,如芽、叶、花和根,其实例包括叶片、针叶、茎、干、花、子实体、果实、种子、根、块茎和根茎。植物部位还包括采收材料以及无性和有性繁殖材料,例如插枝、块茎、根茎、分株及种子。

[0371] 可根据本发明的方法处理的植物包括以下:棉花、亚麻、葡萄藤、水果、蔬菜,如蔷薇科属种(Rosaceae sp.) (例如仁果类,如苹果和梨,以及核果类,例如杏、樱桃、扁桃和桃,以及无核小果类,例如草莓)、Ribesioideae属种、胡桃科属种(Juglandaceae sp.)、桦木科属种(Betulaceae sp.)、漆树科属种(Anacardiaceae sp.)、壳斗科属种(Fagaceae sp.)、桑科属种(Moraceae sp.)、木犀科属种(Oleaceae sp.)、猕猴桃科属种(Actinidaceae sp.)、樟科属种(Lauraceae sp.)、芭蕉科属种(Musaceae sp.) (例如香蕉树和香蕉种植园)、茜草科属种(Rubiaceae sp.) (例如咖啡)、山茶科属种(Theaceae sp.)、梧桐科属种(Sterculiaceae sp.)、芸香科属种(Rutaceae sp.) (例如柠檬、橙子和葡萄柚)、茄科属种(Solanaceae sp.) (例如番茄)、百合科属种(Liliaceae sp.)、紫菀科属种(Asteraceae sp.) (例如莴苣)、伞形科属种(Umbelliferae sp.)、十字花科属种(Cruciferae sp.)、藜科属种(Chenopodiaceae sp.)、葫芦科属种(Cucurbitaceae sp.) (例如黄瓜)、葱科属种(Alliaceae sp.) (例如韭葱、洋葱)、蝶形花科属种(Papilionaceae sp.) (例如豌豆);主要作物植物,如禾本科属种(Gramineae sp.) (例如玉米、草坪草、谷类(如小麦、黑麦、稻、大麦、燕麦、黍和黑小麦))、菊科属种(Asteraceae sp.) (例如向日葵)、十字花科属种(Brassicaceae sp.) (例如白球甘蓝、红球甘蓝、花茎甘蓝、花椰菜、孢子甘蓝、小白菜、球茎甘蓝、小红萝卜,以及油菜、芥菜、辣根和水芹)、豆科属种(Fabaceae sp.) (例如菜豆、花生)、蝶形花科属种(Papilionaceae sp.) (例如大豆)、茄科属种(Solanaceae sp.) (例如马铃薯)、藜科属种(Chenopodiaceae sp.) (例如糖用甜菜、饲用甜菜、瑞士甜菜、甜菜根);园林和森林中的有用植物和观赏植物;以及这些植物各自的基因修饰品种。

[0372] 在一些优选的实施方案中,根据本发明对野生植物物种和植物栽培种或通过常规生物育种方法(例如交叉或原生质体融合)获得的那些植物及其部位进行处理。

[0373] 在一些其他优选的实施方案中,根据本发明的方法对通过基因工程方法(如果合适,与常规方法结合)获得的转基因植物和植物栽培种(遗传修饰生物体)及其部位进行处理。更优选地,市售的或使用中的植物栽培种的植物均可根据本发明进行处理。植物栽培种应理解为意指具有新特性(“性状”)并已通过常规育种方法、诱变或重组DNA技术获得的植

物。它们可以是栽培种、变种、生物型或基因型。

[0374] 本发明的处理方法可用于处理遗传修饰生物体 (GMO), 例如植物或种子。遗传修饰植物 (或转基因植物) 是将异源基因稳定地整合到基因组中的植物。表述“异源基因”主要指在植物体外提供或组装的基因, 并且当将该基因引入细胞核、叶绿体或线粒体基因组时, 通过表达受关注的蛋白质或多肽或者通过下调或沉默存在于植物内的一种或多种其他基因 (例如使用反义技术、共抑制技术或RNA干扰-[RNAi]-技术或微RNA-miRNA-技术) 从而赋予转化植物新的或改进的农学特性或其他特性。位于基因组内的异源基因也被称为转基因。根据其在植物基因组内的具体位置而定义的转基因称为转化株系或转基因株系。

[0375] 根据上文公开的方法处理的植物及植物栽培种包括具有赋予这些植物特别有利的有用性状的基因材料的所有植物 (不论是否通过育种和/或生物技术法获得)。

[0376] 可以通过上述公开的方法处理的植物和植物栽培种包括对一种或多种生物胁迫具有抗性的植物和植物栽培种, 即所述植物对动物和微生物有害物 (例如线虫、昆虫、螨类、植物病原性真菌、细菌、病毒和/或类病毒) 具有更好的防御。

[0377] 可以通过上述公开的方法处理的植物和植物栽培种包括那些对一种或多种非生物胁迫具有抗性的植物。非生物胁迫条件可包括例如干旱、低温暴露、热暴露、渗透胁迫、水涝、提高的土壤盐度、增强的矿物暴露、臭氧暴露、强光暴露、有限的氮营养素利用率、有限的磷营养素利用率、避荫。

[0378] 可以通过上述公开的方法处理的植物和植物栽培种包括那些以提高的产量特性为特征的植物。所述植物中提高的产量可为以下因素的结果: 例如, 改良的植物生理机能、生长和发育, 如水利用效率、持水效率、改善的氮利用率、增强的碳同化作用、改善的光合作用、提高的发芽率和加速的成熟。产量还可受到改进的植物体系结构 (plant architecture) 的影响 (在胁迫和非胁迫条件下), 所述植物体系结构包括但不限于: 提早开花、对杂交种子生产的开花控制、幼苗活力、植株大小、节间数和节间距、根系生长、种子大小、果实大小、荚果大小、荚果数或穗数、每个荚果或穗的种子数量、种子质量、增强的种子饱满度、减少的种子散布、减少的荚开裂以及抗倒伏。其他的产量性状包括种子组成, 如碳水化合物含量和组成, 例如棉花或淀粉、蛋白质含量、油含量和组成、营养价值、抗营养化合物减少、改善的可加工性和更好的贮存稳定性。

[0379] 可以通过上述公开的方法处理的植物和植物栽培种包括为杂交植物的植物和植物栽培种, 该杂交植物已表达出杂种优势或杂交活力的特征, 这通常导致更高的产量、活力、健康和对生物和非生物胁迫的抗性。

[0380] 可以通过上述公开的方法处理的植物和植物栽培种 (通过植物生物技术方法例如基因工程而获得) 包括这样的植物或植物栽培种, 其为除草剂耐受性植物, 即对一种或多种给定的除草剂具有耐受性的植物。这类植物可通过遗传转化或通过选择包含赋予这类除草剂耐受性的突变的植物而获得。

[0381] 可以通过上述公开的方法处理的植物和植物栽培种 (通过植物生物技术方法例如基因工程获得) 包括这样的植物或植物栽培种, 其为昆虫抗性转基因植物, 即对某些目标昆虫的侵袭具有抗性的植物。这类植物可通过遗传转化或通过选择包含赋予这类昆虫抗性的突变的植物而获得。

[0382] 可以通过上述公开的方法处理的植物和植物栽培种 (通过植物生物技术方法例如

基因工程获得) 包括对非生物胁迫具有耐受性的植物和植物栽培种。这类植物可通过遗传转化或通过选择包含赋予这类胁迫抗性的突变的植物而获得。

[0383] 可以通过上述公开的方法处理的植物和植物栽培种(通过植物生物技术方法如基因工程获得) 包括这样的植物或植物栽培种,其显示出改变的采收产品的数量、质量和/或贮存稳定性,和/或改变的采收产品的特定成分的性质。

[0384] 可以通过上述公开的方法处理的植物和植物栽培种(通过植物生物技术方法如基因工程获得) 包括具有改变的纤维特性的植物和植物栽培种,例如棉花植物。这类植物可通过遗传转化或通过选择包含赋予这类改变的纤维特性的突变的植物而获得。

[0385] 可以通过上述公开的方法处理的植物和植物栽培种(通过植物生物技术方法如基因工程获得) 包括具有改变的油分布特性的植物和植物栽培种,例如油菜或相关的芸苔属(*Brassica*)植物。这类植物可通过遗传转化或通过选择包含赋予这类改变的油分布特性的突变的植物而获得。

[0386] 可以通过上述公开的方法处理的植物和植物栽培种(通过植物生物技术方法如基因工程获得) 包括具有改变的种子落粒(*shattering*)特性的植物和植物栽培种,例如油菜或相关的芸苔属(*Brassica*)植物。这类植物可通过遗传转化或通过选择包含赋予这类改变的种子落粒特征的突变的植物而获得,且包括具有延迟或减少的种子落粒的植物,例如油菜植物。

[0387] 可以通过上述公开的方法处理的植物和植物栽培种(通过植物生物技术方法如基因工程获得) 包括具有改变的翻译后蛋白质修饰模式的植物和植物栽培种,例如烟草植株。

[0388] 病原体和病害

[0389] 上文公开的方法可用于防治微生物,特别是引起病害的植物病原性微生物,例如植物病原性真菌,如:

[0390] 由白粉病病原体引起的病害,所述病原体为例如:布氏白粉菌属(*Blumeria*)属种(例如禾本科布氏白粉菌(*Blumeria graminis*))、叉丝单囊壳属(*Podosphaera*)属种(例如白叉丝单囊壳(*Podosphaera leucotricha*))、单囊壳属(*Sphaerotheca*)属种(例如凤仙花单囊壳(*Sphaerotheca fuliginea*))、钩丝壳属(*Uncinula*)属种(例如葡萄钩丝壳(*Uncinula necator*));

[0391] 由锈病病原体引起的病害,所述病原体为例如:胶锈菌属(*Gymnosporangium*)属种(例如褐色胶锈菌(*Gymnosporangium sabinae*));驼孢锈属(*Hemileia*)属种(例如咖啡驼孢锈菌(*Hemileia vastatrix*));层锈菌属(*Phakopsora*)属种(例如豆薯层锈菌(*Phakopsora pachyrhizi*)和山马蝗层锈菌(*Phakopsora meibomiae*));柄锈菌属(*Puccinia*)属种(例如隐匿柄锈菌(*Puccinia recondite*)、小麦叶锈菌(*P. tritricina*)、禾柄锈菌(*P. graminis*)或条形锈菌(*P. striiformis*));单胞锈菌属(*Uromyces*)属种(例如疣顶单胞锈菌(*Uromyces appendiculatus*));

[0392] 由卵菌纲(*Oomycetes*)病原体引起的病害,所述病原体为例如:白锈属(*Albugo*)属种(例如白锈菌(*Albugo candida*));盘霜霉属(*Bremia*)属种(例如莴苣盘霜霉(*Bremia lactucae*));霜霉属(*Peronospora*)属种(例如豌豆霜霉(*Peronospora pisi*)或十字花科霜霉(*P. brassicae*));疫霉属(*Phytophthora*)属种(例如致病疫霉(*Phytophthora infestans*));轴霜霉属(*Plasmopara*)属种(例如葡萄生轴霜霉(*Plasmopara viticola*));假

霜霉属(*Pseudoperonospora*) 属种(例如草假霜霉(*Pseudoperonospora humuli*)或古巴假霜霉(*Pseudoperonospora cubensis*));腐霉属(*Pythium*) 属种(例如终极腐霉(*Pythium ultimum*));

[0393] 由以下病原体引起的叶斑枯病和叶萎蔫病病害:例如,链格孢属(*Alternaria*) 属种(例如早疫病链格孢(*Alternaria solani*));尾孢属(*Cercospora*) 属种(例如萹菜生尾孢(*Cercospora beticola*));枝孢属(*Cladosporium*) 属种(例如黄瓜枝孢(*Cladosporium cucumerinum*));旋孢腔菌属(*Cochliobolus*) 属种(例如禾旋孢腔菌(*Cochliobolus sativus*))(分生孢子形式:德氏霉属(*Drechslera*),同义词:长蠕孢属(*Helminthosporium*))、宫部旋孢腔菌(*Cochliobolus miyabeanus*));炭疽菌属(*Colletotrichum*) 属种(例如菜豆炭疽菌(*Colletotrichum lindemuthianum*));锈斑病菌属(*Cycloconium*) 属种(例如油橄榄孔雀斑病菌(*Cycloconium oleaginum*));间座壳属(*Diaporthe*) 属种(例如柑桔间座壳(*Diaporthe citri*));痂囊腔菌属(*Elsinoe*) 属种(例如柑桔痂囊腔菌(*Elsinoe fawcettii*));盘长孢属(*Gloeosporium*) 属种(例如悦色盘长孢(*Gloeosporium laeticolor*));小丛壳属(*Glomerella*) 属种(例如围小丛壳(*Glomerella cingulata*));球座菌属(*Guignardia*) 属种(例如葡萄球座菌(*Guignardia bidwelli*));小球腔菌属(*Leptosphaeria*) 属种(例如斑污小球腔菌(*Leptosphaeria maculans*));大毁壳属(*Magnaporthe*) 属种(例如灰色大毁壳(*Magnaporthe grisea*));微座孢属(*Microdochium*) 属种(例如雪霉微座孢(*Microdochium nivale*));球腔菌属(*Mycosphaerella*) 属种(例如禾生球腔菌(*Mycosphaerella graminicola*)、落花生球腔菌(*Mycosphaerella arachidicola*)和斐济球腔菌(*Mycosphaerella fijiensis*));暗球腔菌属(*Phaeosphaeria*) 属种(例如小麦颖枯病菌(*Phaeosphaeria nodorum*));核腔菌属(*Pyrenophora*) 属种(例如圆核腔菌(*Pyrenophora teres*)、偃麦草核腔菌(*Pyrenophora tritici repentis*));柱隔孢属(*Ramularia*) 属种(例如辛加柱隔孢(*Ramularia collycyni*)或白斑柱隔孢(*Ramularia areola*));喙孢属(*Rhynchosporium*) 属种(例如黑麦喙孢(*Rhynchosporium secalis*));针孢属(*Septoria*) 属种(例如芹菜小壳针孢(*Septoria apii*)或番茄壳针孢(*Septoria lycopersii*));壳多胞菌属(*Stagonospora*) 属种(例如 *Stagonospora nodorum*);核瑚菌属(*Typhula*) 属种(例如肉孢核瑚菌(*Typhula incarnata*));黑星菌属(*Venturia*) 属种(例如苹果黑星菌(*Venturia inaequalis*));

[0394] 由以下病原体引起的根和茎病害:例如,伏革菌属(*Corticium*) 属种(例如禾伏革菌(*Corticium graminearum*));镰孢属(*Fusarium*) 属种(例如尖镰孢(*Fusarium oxysporum*));顶囊壳菌属(*Gaeumannomyces*) 属种(例如禾顶囊壳(*Gaeumannomyces graminis*));根肿菌属(*Plasmodiophora*) 属种(例如芸薹根肿菌(*Plasmodiophora brassicae*));丝核菌属(*Rhizoctonia*) 属种(例如立枯丝核菌(*Rhizoctonia solani*));由例如稻帚枝杆孢(*Sarocladium oryzae*)引起的帚枝杆孢属(*Sarocladium*)病害;由例如稻腐小核菌(*Sclerotium oryzae*)引起的小核菌属(*Sclerotium*)病害;Tapesia属种(例如 *Tapesia acuformis*);根串珠霉属(*Thielaviopsis*) 属种(例如根串珠霉(*Thielaviopsis basicola*));

[0395] 由以下病原体引起的肉穗花序和圆锥花序病害(包括玉米穗轴):例如,链格孢属(*Alternaria*) 属种(例如链格孢属(*Alternaria* spp.));曲霉属(*Aspergillus*) 属种(例如

黄曲霉 (*Aspergillus flavus*); 枝孢属 (*Cladosporium*) 属种 (例如芽枝状枝孢 (*Cladosporium cladosporioides*)); 麦角菌属 (*Claviceps*) 属种 (例如麦角菌 (*Claviceps purpurea*)); 镰孢属 (*Fusarium*) 属种 (例如黄色镰孢 (*Fusarium culmorum*)); 赤霉属 (*Gibberella*) 属种 (例如玉蜀黍赤霉 (*Gibberella zeae*)); 小画线壳属 (*Monographella*) 属种 (例如雪腐小画线壳 (*Monographella nivalis*)); 壳多孢属 (*Stagnospora*) 属种 (例如 *Stagnospora nodorum*);

[0396] 由黑粉菌引起的病害, 所述病原体为例如: 轴黑粉菌属 (*Sphacelotheca*) 属种 (例如丝孢堆黑粉菌 (*Sphacelotheca reiliana*)); 腥黑粉菌属 (*Tilletia*) 属种 (例如小麦网腥黑粉菌 (*Tilletia caries*) 或小麦矮腥黑粉菌 (*Tilletia controversa*)); 条黑粉菌属 (*Urocystis*) 属种 (例如隐条黑粉菌 (*Urocystis occulta*)); 黑粉菌属 (*Ustilago*) 属种 (例如裸黑粉菌 (*Ustilago nuda*));

[0397] 由以下病原体引起的果实腐烂病: 例如, 曲霉属 (*Aspergillus*) 属种 (例如黄曲霉 (*Aspergillus flavus*)); 葡萄孢属 (*Botrytis*) 属种 (例如灰葡萄孢 (*Botrytis cinerea*)); 青霉属 (*Penicillium*) 属种 (例如扩展青霉 (*Penicillium expansum*) 和产紫青霉 (*Penicillium purpurogenum*)); 根霉属 (*Rhizopus*) 属种 (例如匍枝根霉 (*Rhizopus stolonifer*)); 核盘菌属 (*Sclerotinia*) 属种 (例如核盘菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*)); 轮枝孢属 (*Verticillium*) 属种 (例如黑白轮枝孢 (*Verticillium alboatrum*));

[0398] 由下述病原体引起的种传和土传的腐烂和萎蔫病害以及幼苗病害: 例如, 链格孢属 (*Alternaria*) 属种 (例如芸薹链格孢 (*Alternaria brassicicola*)); 丝囊霉属 (*Aphanomyces*) 属种 (例如根腐丝囊霉 (*Aphanomyces euteiches*)); 壳二孢属 (*Ascochyta*) 属种 (例如兵豆壳二孢 (*Ascochyta lentis*)); 曲霉属 (*Aspergillus*) 属种 (例如黄曲霉 (*Aspergillus flavus*)); 枝孢属 (*Cladosporium*) 属种 (例如草本枝孢 (*Cladosporium herbarum*)); 旋孢腔菌属 (*Cochliobolus*) 属种 (例如禾旋孢腔菌 (*Cochliobolus sativus*) (分生孢子形式: 内脐蠕孢属, 离蠕孢属 (*Bipolaris*) 同义词: 长蠕孢菌)); 炭疽菌属 (*Colletotrichum*) 属种 (例如毛核炭疽菌 (*Colletotrichum coccodes*)); 镰孢属 (*Fusarium*) 属种 (例如黄色镰孢 (*Fusarium culmorum*)); 赤霉属 (*Gibberella*) 属种 (例如玉蜀黍赤霉 (*Gibberella zeae*)); 壳球孢属 (*Macrophomina*) 属种 (例如菜豆壳球孢 (*Macrophomina phaseolina*)); 微结节菌属 (*Microdochium*) 属种 (例如雪霉叶枯菌 (*Microdochium nivale*)); 小画线壳属 (*Monographella*) 属种 (例如雪腐小画线壳 (*Monographella nivalis*)); 青霉属 (*Penicillium*) 属种 (例如扩展青霉 (*Penicillium expansum*)); 茎点霉属 (*Phoma*) 属种 (例如黑胫茎点霉 (*Phoma lingam*)); 拟茎点霉属 (*Phomopsis species*) 属种 (例如大豆拟茎点霉 (*Phomopsis sojae*)); 疫霉属 (*Phytophthora*) 属种 (例如恶疫霉 (*Phytophthora cactorum*)); 核腔菌属 (*Pyrenophora*) 属种 (例如麦类核腔菌 (*Pyrenophora graminea*)); 梨孢属 (*Pyricularia*) 属种 (例如稻梨孢 (*Pyricularia oryzae*)); 腐霉属 (*Pythium*) 属种 (例如终极腐霉 (*Pythium ultimum*)); 丝核菌属 (*Rhizoctonia*) 属种 (例如立枯丝核菌 (*Rhizoctonia solani*)); 根霉菌属 (*Rhizopus*) 属种 (例如稻根霉菌 (*Rhizopus oryzae*)); 小核菌属 (*Sclerotium*) 属种 (例如齐整小核菌 (*Sclerotium rolfsii*)); 壳针孢属 (*Septoria*) 属种 (例如颖枯壳针孢 (*Septoria nodorum*)); 核瑚菌属 (*Typhula*) 属种 (例如肉孢核瑚菌 (*Typhula incarnata*)); 轮枝孢菌属

(*Verticillium*) 属种(例如大丽花轮枝孢(*Verticillium dahliae*));

[0399] 由以下病原体引起的癌性病害、菌瘿和扫帚病:例如,丛赤壳属(*Nectria*) 属种(例如仁果干癌丛赤壳菌(*Nectria galligena*));

[0400] 由以下病原体引起的萎蔫病害:例如,链核盘菌属(*Monilinia*) 属种(例如核果链核盘菌(*Monilinia laxa*));

[0401] 由下述病原体引起的叶、花和果实的变形:例如,外担菌(*Exobasidium*) 属(例如损坏外担菌(*Exobasidium vexans*));外囊菌属(*Taphrina*) (例如桃外囊菌(*Taphrina deformans*));

[0402] 由以下病原体引起的木本植物退行性病:例如,依科(*Esca*) 属种(例如根霉格孢菌(*Phaemoniella clamydospora*)、鸡腿蘑丝孢菌(*Phaeoacremonium aleophilum*)和地中海孢孔菌(*Fomitiporia mediterranea*));灵芝属(*Ganoderma*) 属种(例如岛灵芝(*Ganoderma boninense*));

[0403] 由以下病原体引起的花和种子的病害:例如,葡萄孢属(*Botrytis*) 属种(例如灰葡萄孢(*Botrytis cinerea*));

[0404] 由以下病原体引起的植物块茎病害:例如,丝核菌属(*Rhizoctonia*) 属种(例如立枯丝核菌(*Rhizoctonia solani*));长蠕孢菌属(*Helminthosporium*) 属种(例如茄病长蠕孢(*Helminthosporium solani*));

[0405] 由以下细菌性病原体引起的病害:例如,黄单胞菌属(*Xanthomonas*) 属种(例如稻黄单胞菌白叶枯变种(*Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*));假单胞菌属(*Pseudomonas*) 属种(例如丁香假单胞菌黄瓜致病变种(*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*));欧文氏菌属(*Erwinia*) 属种(例如噬淀粉欧文氏菌(*Erwinia amylovora*))。

[0406] 种子处理

[0407] 防治不想要的微生物的方法可用于保护种子免受植物病原性微生物如真菌的侵害。

[0408] 如本文所用的术语“种子”包括休眠种子、预处理的种子、预发芽的种子和已出现根和叶的种子。

[0409] 因此,本发明还涉及保护种子和/或作物免于不想要的微生物(如细菌或真菌)的侵害的方法,其包括以下步骤:用一种或多种式(I)的化合物或包含其的组合物处理种子。用一种或多种式(I)的化合物或包含其的组合物对种子进行处理不仅保护种子免于植物病原性微生物的侵害,而且还保护了发芽的植物、出苗的幼苗和出苗后的植物。

[0410] 种子处理可以在播种之前、播种时或播种之后不久进行。

[0411] 当在播种之前进行种子处理时(例如,所谓在种子上施用),可以按以下步骤进行种子处理:可以将种子放入包含所需量的式(I)的化合物或含其的组合物(原样或稀释后)的混合器中,使种子和式(I)的化合物或包含其的组合物混合,直至均匀分布在种子上。如果合适,可以将随后种子进行干燥。

[0412] 本发明还涉及用一种或多种式(I)的化合物或包含其的组合物处理的种子。如上所述,使用经处理的种子不仅可以在播种前和播种后保护种子免于不想要的微生物(例如植物病原性真菌)的侵害,而且还可以保护由所述经处理的种子长出的发芽植物和幼苗。有害生物对作物植物造成的大部分损害是由播种前或植物发芽后种子的感染引发的。这个阶

段特别关键,因为正在生长的植物的根和芽特别敏感,即使是很小的损害也可能导致植物死亡。

[0413] 因此,本发明还涉及保护种子、发芽植物和出苗的幼苗的方法,更概括地涉及一种保护作物免受植物病原性微生物侵害的方法,其包括以下步骤:使用经一种或多种式(I)的化合物或包含其的组合物处理种子。

[0414] 优选地,在种子足够稳定以在处理过程中不发生损害的状态下处理种子。通常,可在采收和刚播种后之间的任意时间处理种子。通常使用已从植物中分离,并已经除去芯、壳、茎、皮、绒毛或果肉的种子。例如,可使用已经采收、清洁并干燥至含水量小于15重量%的种子。或者,还可使用干燥后例如用水处理并再次干燥的种子,或者仅预处理后的种子,或在预处理条件中储存的种子或预发芽的种子,或者种植于苗圃托盘、条带或纸上的种子。

[0415] 施用于种子的式(I)的化合物或包含其的组合物通常使得种子的发芽不受损害,或长成的植物不受损害。特别是对于在某些施用率下可表现出植物毒性作用的活性成分的情况下,必须确保这点。在确定施用至种子的式(I)的化合物或包含其的组合物时还应当考虑转基因植物固有的表型,从而使用最少量的式(I)的化合物或包含其的组合物实现对种子和发芽植物的最佳保护。

[0416] 如上所述,式(I)的化合物可以直接施用于种子,即不使用任何其他组分且不经稀释,或者可以施用包含式(I)的化合物的组合物。优选地,将组合物以任何合适的形式施用于种子。合适的制剂的实例包括溶液剂、乳剂、悬浮剂、粉剂、泡沫剂、浆液或与用于种子的其他包衣组合物组合,例如成膜材料、丸粒材料、细铁粉或其他金属粉末、颗粒、用于灭活种子的包衣材料,以及ULV制剂。制剂可以是即用型制剂或可以是使用前需要稀释的浓缩物。

[0417] 这些制剂以已知的方式来制备,例如通过将活性成分或其混合物与常规添加剂混合,常规添加剂为例如常规增量剂以及溶剂或稀释剂、染料、润湿剂、分散剂、乳化剂、消泡剂、防腐剂、二次增稠剂、胶粘剂、赤霉素以及水。

[0418] 这些制剂以已知的方式来制备,通过将活性成分或活性成分结合物与常规添加剂混合,常规添加剂为例如常规增量剂以及溶剂或稀释剂、染料、润湿剂、分散剂、乳化剂、消泡剂、防腐剂、二次增稠剂、胶粘剂、赤霉素以及水。

[0419] 可存在于拌种制剂中的有用染料为常用于此目的的所有染料。可使用微溶于水的颜料,或溶于水的染料。实例包括已知的名称为罗丹明B、C.I. 颜料红112和C.I. 溶剂红1的染料。可存在于拌种制剂中的有用润湿剂为促进润湿且常用于活性农业化学成分制剂的所有物质。优选使用萘磺酸烷基酯,例如萘磺酸二异丙酯或萘磺酸二异丁酯。可存在于拌种制剂中的有用分散剂和/或乳化剂为常用于活性农业化学成分制剂的所有非离子、阴离子和阳离子分散剂。可优选使用非离子或阴离子分散剂或非离子或阴离子分散剂的混合物。合适的非离子分散剂特别包括环氧乙烷/环氧丙烷嵌段聚合物、烷基酚聚乙二醇醚和三苯乙基酚聚乙二醇醚,以及其磷酸化或硫酸化衍生物。合适的阴离子分散剂特别为木质素磺酸盐、聚丙烯酸盐和芳基磺酸盐/甲醛缩合物。可存在于拌种制剂中的消泡剂为常用于活性农业化学成分制剂的所有泡沫抑制物质。可优选使用硅酮消泡剂和硬脂酸镁。可存在于拌种制剂中的防腐剂为可在农业化学组合物中用于此目的的所有物质。实例包括双氯酚和苯醇半缩甲醛。可存在于拌种制剂中的二次增稠剂为可在农业化学组合物中用于此目的的所有物质。优选的实例包括纤维素衍生物、丙烯酸衍生物、黄原胶、改性粘土和细分散的二

氧化硅。可存在于拌种制剂中的胶粘剂为可用于拌种产品的所有常规粘合剂。优选的实例包括聚乙烯吡咯烷酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇和甲基纤维素。

[0420] 式(I)的化合物和包含其的组合物适用于保护用于农业、温室、森林或园艺的任何植物品种的种子。更具体地,种子是谷物(例如小麦、大麦、黑麦、小米、黑小麦和燕麦)、油菜、玉米、棉花、大豆、稻、马铃薯、向日葵、豆类、咖啡、豌豆、甜菜(例如糖用甜菜和饲料甜菜)、花生、蔬菜(如番茄、黄瓜、洋葱和生菜)、草坪和观赏植物。特别重要的是小麦、大豆、油菜、玉米和稻种子的处理。

[0421] 式(I)的化合物或包含其的组合物可用于处理转基因种子,特别是能够表达对抗有害物、除草损害或非生物胁迫的蛋白质的植物种子,从而增加保护作用。协同作用也可能发生在与表达形成的物质的相互作用中。

[0422] 线虫

[0423] 在本文中,术语“线虫”包括线虫动物门的所有物种,并且在本文中特别是作为寄生虫作用于植物或真菌的物种(例如,滑刃目(Aphelenchida)、根结线虫属(Meloidogyne)、垫刃目(Tylenchida)等的物种)或作用于人和动物的物种(例如,毛形线虫科(Trichinellida)、垫刃目、杆形目(Rhabditida)和旋尾目(Spirurida)的物种)和在这些活的生物体中或生物体上造成损害的物种,以及其他寄生蠕虫。

[0424] 如本文所述,作物保护中的杀线虫剂能够防治线虫。

[0425] 术语“防治线虫”意指杀死线虫或预防或阻止其发育或其生长或者预防或阻止其渗入或吸食植物组织。

[0426] 在本文中,化合物的功效如下确定:通过比较用式(I)的化合物处理的植物或植物部位或者经处理的土壤与未处理的植物或植物部位或未处理的土壤(100%)之间的线虫死亡率、虫瘿(gall)形成、孢囊(cyst)形成、每体积土壤的线虫密度、每个根部的线虫密度、每体积土壤的线虫卵数量、线虫的活动性。优选地,与未处理的植物、植物部位或未处理的土壤相比,所达到的减少为25-50%,特别优选51-79%,且非常特别优选通过达到80%至100%的减少而完全杀灭线虫或完全预防线虫的发育和生长。本文所述的防治线虫还包括防治线虫繁殖(孢囊和/或卵的发育)。式(I)的化合物还可用于保持植物或动物健康,并且它们可治疗性、预防性或内吸性(systemically)地用于防治线虫。

[0427] 本领域技术人员知晓测定线虫死亡率、虫瘿形成、孢囊形成、每体积土壤的线虫密度、每个根部的线虫密度、每体积土壤的线虫卵数量、线虫的活动性的方法。

[0428] 使用式(I)的化合物可保持植物健康,并且还包括减少由线虫引起的损害和增加采收产量。

[0429] 在本文中,术语“线虫”指植物线虫,其包括所有损害植物的线虫。植物线虫包括植物寄生线虫和土传线虫。植物寄生线虫包括体外寄生虫,例如剑线虫属种(Xiphinema spp.)、长针线虫属种(Longidorus spp.)和毛刺线虫属种(Trichodorus spp.);半寄生虫,例如半穿刺线虫属种(Tylenchulus spp.);迁移性内寄生虫,例如短体线虫属种(Pratylenchus spp.)、穿孔线虫属种(Radopholus spp.)和盾线虫属种(Scutellonema spp.);非迁移性寄生虫,例如异皮线虫属种(Heterodera spp.)、球异皮线虫属种(Globodera spp.)和根结线虫属种(Meloidogyne spp.);以及茎和叶内寄生虫,例如茎线虫属种(Ditylenchus spp.)、滑刃线虫属种(Aphelenchoides spp.)和潜根线虫属种

(*Hirschmaniella* spp.)。特别有害的根部寄生的土壤线虫为,例如,异皮线虫属或球异皮线虫属的形成孢囊的线虫,和/或根结线虫属的根瘿线虫。这些属的有害物种为,例如,南方根结线虫(*Meloidogyne incognita*)、大豆异皮线虫(*Heterodera glycines*) (大豆孢囊线虫)、马铃薯白线虫(*Globodera pallida*)和马铃薯金线虫(*Globodera rostochiensis*) (黄马铃薯孢囊线虫),通过本文所述的化合物可有效防治这些物种。但是,本文所述的化合物的用途绝不限于这些属或物种,而是以相同方式扩展至其他线虫。

[0430] 植物线虫包括,例如,居农野外垫刃线虫(*Aglenchus agricola*);小麦粒线虫(*Anguina tritici*);花生滑刃线虫(*Aphelenchoides arachidis*)、草莓滑刃线虫(*Aphelenchoides fragaria*)和滑刃线虫属(*Aphelenchoides* spp.)的茎和叶内寄生虫;细小刺线虫(*Belonolaimus gracilis*)、长尾刺线虫(*Belonolaimus longicaudatus*)、*Belonolaimus nortoni*、椰子红环腐线虫(*Bursaphelenchus cocophilus*)、荒漠伞滑刃线虫(*Bursaphelenchus eremus*)、松材线虫(*Bursaphelenchus xylophilus*)和伞滑刃线虫属(*Bursaphelenchus* spp.);*Cacopaurus pestis*;弯曲小环线虫(*Criconemella curvata*)、俄尼小环线虫(*Criconemella onoensis*)、装饰小环线虫(*Criconemella ornata*)、*Criconemella rusium*、薄叶小环线虫(*Criconemella xenoplax*) (= *Mesocriconema xenoplax*)和小环线虫属(*Criconemella* spp.);*Criconemoides ferniae*、*Criconemoides onoense*、*Criconemoides ornatum*和轮线虫属(*Criconemoides* spp.);马铃薯茎线虫(*Ditylenchus destructor*)、鳞球茎茎线虫(*Ditylenchus dipsaci*)、食菌茎线虫(*Ditylenchus myceliophagus*)以及茎线虫属(*Ditylenchus* spp.)的茎和叶内寄生虫;*Dolichodorus heterocephalus*、马铃薯白线虫(*Globodera pallida*) (= 苍白异皮线虫(*Heterodera pallida*))、马铃薯金线虫(*Globodera rostochiensis*) (马铃薯孢囊线虫)、茄球皮线虫(*Globodera solanacearum*)、烟草孢囊线虫(*Globodera tabacum*)、弗吉尼亚球皮线虫(*Globodera virginia*)和球异皮线虫属(*Globodera* spp.)的非迁移性的形成孢囊的寄生虫;双角螺旋线虫(*Helicotylenchus digonicus*)、双宫螺旋线虫(*Helicotylenchus dihystra*)、刺桐螺旋线虫(*Helicotylenchus erythrine*)、多带螺旋线虫(*Helicotylenchus multicinctus*)、短螺旋线虫(*Helicotylenchus nannus*)、假强壮螺旋线虫(*Helicotylenchus pseudorobustus*)和螺旋线虫属(*Helicotylenchus* spp.);半轮线虫属(*Hemicriconemoides*);花生鞘线虫(*Hemicycliophora arenaria*)、*Hemicycliophora nudata*、微细鞘线虫(*Hemicycliophora parvana*);燕麦异皮线虫(*Heterodera avenae*)、十字花科异皮线虫(*Heterodera cruciferae*)、大豆异皮线虫(*Heterodera glycines*) (大豆孢囊线虫)、水稻异皮线虫(*Heterodera oryzae*)、甜菜异皮线虫(*Heterodera schachtii*)、玉米异皮线虫(*Heterodera zae*)和异皮线虫属(*Heterodera* spp.)的非迁移性的形成孢囊的寄生虫;纤细潜根线虫(*Hirschmaniella gracilis*)、水稻潜根线虫(*Hirschmaniella oryzae*)、刺尾潜根线虫(*Hirschmaniella spinicaudata*)和潜根线虫属(*Hirschmaniella* spp.)的茎和叶内寄生虫,埃及纽带线虫(*Hoplolaimus aegyptii*)、加利福尼亚纽带线虫(*Hoplolaimus californicus*)、哥伦比亚纽带线虫(*Hoplolaimus columbus*)、帽状纽带线虫(*Hoplolaimus galeatus*)、印度纽带线虫(*Hoplolaimus indicus*)、大针纽带线虫(*Hoplolaimus magnistylus*)、似强壮纽带线虫(*Hoplolaimus pararobustus*);非洲长针线虫(*Longidorus africanus*)、短环长针线虫(*Longidorus breviannulatus*)、逃逸长针线虫

(*Longidorus elongatus*)、*Longidorus laevicapitatus*、*Longidorus vineacola*和长针线虫属(*Longidorus* spp.)的体外寄生虫;高粱根结线虫(*Meloidogyne acronea*)、非洲根结线虫(*Meloidogyne africana*)、花生根结线虫(*Meloidogyne arenaria*)、*Meloidogyne arenaria thamesi*、甘蓝根结线虫(*Meloidogyne artiella*)、奇氏根结线虫(*Meloidogyne chitwoodi*)、咖啡根结线虫(*Meloidogyne coffeicola*)、埃塞俄比亚根结线虫(*Meloidogyne ethiopica*)、短小根结线虫(*Meloidogyne exigua*)、伪根结线虫(*Meloidogyne fallax*)、禾草根结线虫(*Meloidogyne graminicola*)、禾本科根结线虫(*Meloidogyne graminis*)、北方根结线虫(*Meloidogyne hapla*)、南方根结线虫(*Meloidogyne incognita*)、*Meloidogyne incognita acrita*、爪哇根结线虫(*Meloidogyne javanica*)、吉库尤根结线虫(*Meloidogyne kikuyensis*)、较小根结线虫(*Meloidogyne minor*)、纳西根结线虫(*Meloidogyne naasi*)、巴拉纳根结线虫(*Meloidogyne paranaensis*)、泰晤士根结线虫(*Meloidogyne thamesi*)和根结线虫属(*Meloidogyne* spp.)的非迁移性寄生虫;*Meloinema*属;异常珍珠线虫(*Nacobbus aberrans*);*Neotylenchus vigissi*;假墙草异滑刃线虫(*Paraphelenchus pseudoparietinus*);葱拟毛刺线虫(*Paratrichodorus allius*)、*Paratrichodorus lobatus*、较小拟毛刺线虫(*Paratrichodorus minor*)、短小拟毛刺线虫(*Paratrichodorus nanus*)、胼胝拟毛刺线虫(*Paratrichodorus porosus*)、光滑拟毛刺线虫(*Paratrichodorus teres*)和拟毛刺线虫属(*Paratrichodorus* spp.)、具钩针线虫(*Paratylenchus hamatus*)、微小针线虫(*Paratylenchus minutus*)、突出针线虫(*Paratylenchus projectus*)和针线虫属(*Paratylenchus* spp.)、敏捷短体线虫(*Pratylenchus agilis*)、艾伦短体线虫(*Pratylenchus alleni*)、安第斯短体线虫(*Pratylenchus andinus*)、最短尾短体线虫(*Pratylenchus brachyurus*)、谷类短体线虫(*Pratylenchus cerealis*)、咖啡短体线虫(*Pratylenchus coffeae*)、刻痕短体线虫(*Pratylenchus crenatus*)、德拉特短体线虫(*Pratylenchus delattrei*)、*Pratylenchus giibbicaudatus*、*Pratylenchus goodeyi*、具钩短体线虫(*Pratylenchus hamatus*)、六裂短体线虫(*Pratylenchus hexincisus*)、卢斯短体线虫(*Pratylenchus loosi*)、落选短体线虫(*Pratylenchus neglectus*)、穿刺短体线虫(*Pratylenchus penetrans*)、草地短体线虫(*Pratylenchus pratensis*)、斯克里布纳短体线虫(*Pratylenchus scribneri*)、光滑短体线虫(*Pratylenchus teres*)、索氏短体线虫(*Pratylenchus thornei*)、伤残短体线虫(*Pratylenchus vulnus*)、玉米短体线虫(*Pratylenchus zaeae*)和短体线虫属(*Pratylenchus* spp.)的迁移性内寄生虫;*Pseudohalenchus minutus*;*Psilenchus magnidens*、尾粗裸矛线虫(*Psilenchus tumidus*);查尔科斑皮线虫(*Punctodera chalcoensis*)、尖锐五沟线虫(*Quinisulcius acutus*);柑橘穿孔线虫(*Radopholus citrophilus*)、香蕉穿孔线虫(*Radopholus similis*)、穿孔线虫属(*Radopholus* spp.)的迁移性内寄生虫,北方肾型线虫(*Rotylenchulus borealis*)、微小肾型线虫(*Rotylenchulus parvus*)、肾形肾状线虫(*Rotylenchulus reniformis*)和肾型线虫属(*Rotylenchulus* spp.)、直沟盘旋线虫(*Rotylenchus laurentinus*)、大囊盘旋线虫(*Rotylenchus macrodoratus*)、强壮盘旋线虫(*Rotylenchus robustus*)、*Rotylenchus uniformis*和盘旋线虫属(*Rotylenchus* spp.)、小尾盾线虫(*Scutellonema brachyurum*)、缓慢盾线虫(*Scutellonema bradys*)、

*Scutellonema clathricaudatum*和盾线虫属(*Scutellonema* spp.)的迁移性内寄生虫;根瘿亚粒线虫(*Subanguina radiciola*),烟草细垫线虫(*Tetylenchus nicotianae*);圆桶毛刺线虫(*Trichodorus cylindricus*)、小毛刺线虫(*Trichodorus minor*)、原始毛刺线虫(*Trichodorus primitivus*)、邻近毛刺线虫(*Trichodorus proximus*)、相似毛刺线虫(*Trichodorus similis*)、稀少毛刺线虫(*Trichodorus sparsus*)和毛刺线虫属(*Trichodorus* spp.)的体外寄生虫;农田矮化线虫(*Tylenchorhynchus agri*)、甘蓝矮化线虫(*Tylenchorhynchus brassicae*)、清亮矮化线虫(*Tylenchorhynchus clarus*)、克莱顿矮化线虫(*Tylenchorhynchus claytoni*)、指状矮化线虫(*Tylenchorhynchus digitatus*)、*Tylenchorhynchus ebriensis*、最大矮化线虫(*Tylenchorhynchus maximus*)、裸矮化线虫(*Tylenchorhynchus nudus*)、寻常矮化线虫(*Tylenchorhynchus vulgaris*)和矮化线虫属(*Tylenchorhynchus* spp.);柑橘半穿刺线虫(*Tylenchulus semipenetrans*)和半穿刺线虫属(*Tylenchulus* spp.)的半寄生虫;美洲剑线虫(*Xiphinema americanum*)、短颈剑线虫(*Xiphinema brevicolle*)、*Xiphinema dimorphicaudatum*、标准剑线虫(*Xiphinema index*)和剑线虫属(*Xiphinema* spp.)的体外寄生虫。

[0431] 可使用式(I)的化合物来防治的线虫包括:根结线虫属的线虫,例如南方根结线虫(*Meloidogyne incognita*)、爪哇根结线虫(*Meloidogyne javanica*)、北方根结线虫(*Meloidogyne hapla*)和花生根结线虫(*Meloidogyne arenaria*);茎线虫属(*Ditylenchus*)的线虫,例如马铃薯腐烂线虫(马铃薯茎线虫(*Ditylenchus destructor*))和茎和球茎线虫(鳞球茎茎线虫(*Ditylenchus dipsaci*));短体线虫属(*Pratylenchus*)的线虫,例如玉米根损害线虫(穿刺短体线虫(*Pratylenchus penetrans*))、菊根损害线虫(伪短体线虫(*Pratylenchus fallax*))、咖啡根损害线虫(咖啡短体线虫(*Pratylenchus coffeae*))、茶树根损害线虫(卢斯短体线虫(*Pratylenchus loosi*))和胡桃根损害线虫(伤残短体线虫(*Pratylenchus vulnus*));球异皮线虫属(*Globodera*)的线虫,例如黄色马铃薯孢囊线虫(马铃薯金线虫(*Globodera rostochiensis*))和白色马铃薯孢囊线虫(马铃薯白线虫(*Globodera pallida*));异皮线虫属(*Heterodera*)的线虫,例如大豆孢囊线虫(大豆异皮线虫(*Heterodera glycines*))和甜菜孢囊线虫(甜菜异皮线虫(*Heterodera schachtii*));滑刃线虫属(*Aphelenchoides*)的线虫,例如稻干尖线虫(贝西滑刃线虫(*Aphelenchoides besseyi*))、菊叶线虫(菊叶芽滑刃线虫(*Aphelenchoides ritzemabosi*))和草莓线虫(草莓滑刃线虫(*Aphelenchoides fragariae*));真滑刃线虫属(*Aphelenchus*)的线虫,例如食菌线虫(燕麦真滑刃线虫(*Aphelenchus avenae*));穿孔线虫属(*Radopholus*)的线虫,例如掘穴线虫(香蕉穿孔线虫(*Radopholus similis*));半穿刺线虫属(*Tylenchulus*)的线虫,例如柑橘根线虫(柑橘半穿刺线虫(*Tylenchulus semipenetrans*));肾型线虫属(*Rotylenchulus*)的线虫,例如肾形线虫(肾形肾状线虫(*Rotylenchulus reniformis*));存在于树木中的线虫,例如松木线虫(松材线虫(*Bursaphelenchus xylophilus*))和红环线虫(椰子红环腐线虫(*Bursaphelenchus cocophilus*))等。

[0432] 可使用式(I)的化合物来保护的植物包括以下植物:例如谷物(例如,稻、大麦、小麦、黑麦、燕麦、玉米等)、豆类(大豆、红豆、菜豆、蚕豆、豌豆、花生等)、果树/果实(苹果、柑橘类、梨、葡萄、桃、日本杏、樱桃、胡桃、扁桃、香蕉、草莓等)、蔬菜(甘蓝、番茄、菠菜、花椰菜、莴苣、洋葱、大葱、胡椒等)、根作物(胡萝卜、马铃薯、甘薯、萝卜、莲藕、芜菁等)、工业原

料用植物(棉花、大麻、构树、三桠、油菜、甜菜、蛇麻草、甘蔗、糖用甜菜、橄榄、橡胶、棕榈树、咖啡、烟草、茶等)、瓜类(南瓜、黄瓜、西瓜、甜瓜等)、牧草植物(鸭茅草、高粱、梯牧草、三叶草、紫花苜蓿等)、草坪草(结缕草、剪股颖等)、香料植物(薰衣草、迷迭香、百里香、欧芹、胡椒、姜等)等,以及花(菊花、玫瑰、兰花等)。

[0433] 式(I)的化合物特别适用于防治咖啡线虫,特别是最短尾短体线虫(*Pratylenchus brachyurus*)、咖啡短体线虫(*Pratylenchus coffeae*)、短小根结线虫(*Meloidogyne exigua*)、南方根结线虫(*Meloidogyne incognita*)、咖啡根结线虫(*Meloidogyne coffeicola*)、螺旋线虫属种(*Helicotylenchus* spp.)以及巴拉纳根结线虫(*Meloidogyne paranaensis*)、盘旋线虫属种(*Rotylenchus* spp.)、剑线虫属种(*Xiphinema* spp.)、矮化线虫属种(*Tylenchorhynchus* spp.)和盾线虫属种(*Scutellonema* spp.)。

[0434] 式(I)的化合物特别适用于防治马铃薯线虫,特别是最短尾短体线虫、草地短体线虫、斯克里布纳短体线虫、穿刺短体线虫、咖啡短体线虫、鳞球茎茎线虫以及艾伦短体线虫、安第斯短体线虫、谷类短体线虫、刻痕短体线虫、六裂短体线虫、卢斯短体线虫、落选短体线虫、光滑短体线虫、索氏短体线虫、伤残短体线虫、长尾刺线虫、圆桶毛刺线虫、原始毛刺线虫、邻近毛刺线虫、相似毛刺线虫、稀少毛刺线虫、较小拟毛刺线虫、葱拟毛刺线虫、短小拟毛刺线虫、光滑拟毛刺线虫、花生根结线虫、伪根结线虫、北方根结线虫、泰晤士根结线虫、南方根结线虫、奇氏根结线虫、爪哇根结线虫、异常珍珠线虫、马铃薯金线虫、马铃薯白线虫、马铃薯茎线虫、相似穿孔线虫、肾形肾状线虫、*Neotylenchus vigissi*、假墙草异滑刃线虫、草莓滑刃线虫和*Meloinema*属种。

[0435] 式(I)的化合物特别适用于防治番茄线虫,特别是花生根结线虫、北方根结线虫、爪哇根结线虫、南方根结线虫、穿刺短体线虫以及最短尾短体线虫、咖啡短体线虫、斯克里布纳短体线虫、伤残短体线虫、较小拟毛刺线虫、短小根结线虫、异常珍珠线虫、茄球皮线虫、*Dolichodorus heterocephalus*和肾形肾状线虫。

[0436] 式(I)的化合物特别适用于防治黄瓜植物线虫,特别是花生根结线虫、北方根结线虫、爪哇根结线虫、南方根结线虫、肾形肾状线虫和索氏短体线虫。

[0437] 式(I)的化合物特别适用于防治棉花线虫,特别是长尾刺线虫、南方根结线虫、哥伦比亚纽带线虫、帽状纽带线虫和肾形肾状线虫。

[0438] 式(I)的化合物特别适用于防治玉米线虫,特别是长尾刺线虫、较小拟毛刺线虫以及最短尾短体线虫、德拉特短体线虫、六裂短体线虫、穿刺短体线虫、玉米短体线虫、(细小刺线虫)、*Belonolaimus nortoni*、短环长针线虫、花生根结线虫、*Meloidogyne arenaria thamesi*、禾本科根结线虫、南方根结线虫、*Meloidogyne incognita acrita*、爪哇根结线虫、纳西根结线虫、燕麦异皮线虫、水稻异皮线虫、玉米异皮线虫、查尔科斑皮线虫、鳞球茎茎线虫、埃及纽带线虫、大针纽带线虫、帽状纽带线虫、印度纽带线虫、双角螺旋线虫、双宫螺旋线虫、假强壮螺旋线虫、美洲剑线虫、*Dolichodorus heterocephalus*、装饰小环线虫、俄尼小环线虫、相似穿孔线虫、北方肾型线虫、微小肾型线虫、农田矮化线虫、清亮矮化线虫、克莱顿矮化线虫、最大矮化线虫、裸矮化线虫、寻常矮化线虫、尖锐五沟线虫、微小针线虫、微细鞘线虫、居农野外垫刃线虫、小麦粒线虫、花生滑刃线虫、小尾盾线虫和根瘿亚粒线虫。

[0439] 式(I)的化合物特别适用于防治大豆线虫,特别是最短尾短体线虫、草地短体线

虫、穿刺短体线虫、斯克里布纳短体线虫、长尾刺线虫、大豆异皮线虫、哥伦比亚纽带线虫以及咖啡短体线虫、六裂短体线虫、落选短体线虫、刻痕短体线虫、艾伦短体线虫、敏捷短体线虫、玉米短体线虫、伤残短体线虫、(细小刺线虫)、花生根结线虫、南方根结线虫、爪哇根结线虫、北方根结线虫、哥伦比亚纽带线虫、帽状纽带线虫和肾形肾状线虫。

[0440] 式(I)的化合物特别适用于防治烟草线虫,特别是南方根结线虫、爪哇根结线虫以及最短尾短体线虫、草地短体线虫、六裂短体线虫、穿刺短体线虫、落选短体线虫、刻痕短体线虫、索氏短体线虫、伤残短体线虫、玉米短体线虫、逃逸长针线虫、*Paratrichodorus lobatus*、毛刺线虫属种、花生根结线虫、北方根结线虫、烟草孢囊线虫、茄球皮线虫、弗吉尼亚球皮线虫、鳞球茎茎线虫、盘旋线虫属种、螺旋线虫属种、美洲剑线虫、小环线虫属种、肾形肾状线虫、克莱顿矮化线虫、针线虫属种和烟草细垫线虫。

[0441] 式(I)的化合物特别适用于防治柑橘线虫,特别是咖啡短体线虫以及最短尾短体线虫、伤残短体线虫、长尾刺线虫、较小拟毛刺线虫、胼胝拟毛刺线虫、毛刺线虫属、南方根结线虫、*Meloidogyne incognita acrita*、爪哇根结线虫、大囊盘旋线虫、美洲剑线虫、短颈剑线虫、标准剑线虫、小环线虫属种、半轮线虫属、香蕉穿孔线虫和柑橘穿孔线虫、花生鞘线虫、*Hemicycliophora nudata*和柑橘半穿刺线虫。

[0442] 式(I)的化合物特别适用于防治香蕉线虫,特别是咖啡短体线虫、香蕉穿孔线虫以及 *Pratylenchus giibbicaudatus*、卢斯短体线虫、根结线虫属种、多带螺旋线虫、双宫螺旋线虫和肾型线虫属种。

[0443] 式(I)的化合物特别适用于防治菠萝线虫,特别是玉米短体线虫、草地短体线虫、最短尾短体线虫、*Pratylenchus goodeyi*、根结线虫属种、肾形肾状线虫以及逃逸长针线虫、*Longidorus laeviscapitatus*、原始毛刺线虫、小毛刺线虫、异皮线虫属种、食菌茎线虫、加利福尼亚纽带线虫、似强壮纽带线虫、印度纽带线虫、双宫螺旋线虫、短螺旋线虫、多带螺旋线虫、刺桐螺旋线虫、*Xiphinema dimorphicaudatum*、香蕉穿孔线虫、指状矮化线虫、*Tylenchorhynchus ebriensis*、微小针线虫、*Scutellonema clathricaudatum*、缓慢盾线虫、尾粗裸矛线虫、*Psilenchus magnidens*、*Pseudohalenchus minutus*、*Criconemoides ferniae*、*Criconemoides onoense*和 *Criconemoides ornatum*。

[0444] 式(I)的化合物特别适用于防治葡萄线虫,特别是伤残短体线虫、花生根结线虫、南方根结线虫、爪哇根结线虫、美洲剑线虫、标准剑线虫以及草地短体线虫、斯克里布纳短体线虫、落选短体线虫、最短尾短体线虫、索氏短体线虫和柑橘半穿刺线虫。

[0445] 式(I)的化合物特别适用于防治树木作物——仁果中的线虫,特别是穿刺短体线虫以及伤残短体线虫、逃逸长针线虫、南方根结线虫和北方根结线虫。

[0446] 式(I)的化合物特别适用于防治树木作物——核果中的线虫,特别是穿刺短体线虫、伤残短体线虫、花生根结线虫、北方根结线虫、爪哇根结线虫、南方根结线虫、薄叶小环线虫以及最短尾短体线虫、咖啡短体线虫、斯克里布纳短体线虫、玉米短体线虫、长尾刺线虫、双宫螺旋线虫、美洲剑线虫、弯曲小环线虫、克莱顿矮化线虫、具钩针线虫、突出针线虫、小尾盾线虫和帽状纽带线虫。

[0447] 式(I)的化合物特别适用于防治树木作物、甘蔗和稻中的线虫,特别是毛刺线虫属种、小环线虫属种以及短体线虫属种、拟毛刺线虫属种、根结线虫属种、螺旋线虫属种、矮化线虫属种、滑刃线虫属种、异皮线虫属种、剑线虫属种和 *Cacopaurus pestis*。

[0448] 施用

[0449] 式(I)的化合物可以其本身或例如以即用溶液剂、乳剂、水基和油基悬浮剂、粉剂、可湿性粉剂、膏剂、可溶性粉剂、粉末剂、可溶性颗粒剂、撒播颗粒剂、悬乳浓缩剂、经式(I)的化合物浸渍的天然产品、经式(I)的化合物浸渍的合成物质、肥料及聚合物中的微胶囊剂的形式施用。

[0450] 施用以常规方式进行,例如浇灌、喷雾、雾化、撒播、喷粉、发泡、抛撒等。还可通过超低容量法(通过滴灌系统或淋施)施用式(I)的化合物,将其施用到犁沟内或将其注入土茎或树干中。还可以通过伤口密封、油漆或其他伤口敷料来施用式(I)的化合物。

[0451] 施用于植物、植物部位、果实、种子或土壤的式(I)的化合物的有效和植物相容容量将取决于各种因素,例如所用的化合物/组合物、处理的对象(植物、植物部位、果实、种子或土壤)、处理的类型(喷粉、喷洒、拌种)、处理的目的是(治疗性和保护性)、微生物的类型、微生物的发育阶段、微生物的敏感性、作物生长阶段和环境条件。

[0452] 当式(I)的化合物用作杀菌剂时,根据施用的种类,施用率可以在较宽的范围内变化。对于植物部位如叶子的处理,施用率可为0.1至10 000g/ha,优选10至1000g/ha,更优选50至300g/ha(在通过浇水或滴灌施用的情况下,甚至可以降低施用率,尤其是在使用岩棉或珍珠岩等惰性物质时)。对于种子的处理,施用率可以为每100kg种子0.1至200g,优选每100kg种子1至150g,更优选每100kg种子2.5至25g,甚至更优选每100kg种子2.5至12.5g。对于土壤的处理,施用率可为0.1至10 000g/ha,优选1至5000g/ha。

[0453] 这些施用率仅仅是示例,并不旨在限制本发明的范围。

[0454] 材料保护

[0455] 本发明的化合物和组合物还可用于材料的保护,特别是用于保护工业材料免受不想要的微生物的侵袭和破坏。

[0456] 此外,本发明的化合物可单独或与其他活性成分结合用作防污组合物。

[0457] 在本文的上下文中,工业材料理解为意指为了在工业中使用而制备的无生命材料。例如,受保护以免受微生物改变或破坏的工业材料可为胶粘剂、胶水、纸、墙纸和木板/硬纸板、纺织品、地毯、皮革、木材、纤维和织物、油漆和塑料制品、冷却润滑剂和可被微生物侵袭或破坏的其他材料。在待保护的材料的范围内还可提及生产设备和建筑物的部件,例如冷却水回路、冷却和加热系统以及通风单元和空调设备,其可受微生物繁殖的侵害。在本发明的范围内,工业材料优选包括胶粘剂、胶料、纸和卡片、皮革、木材、油漆、冷却润滑剂和传热流体,更优选木材。

[0458] 本发明的化合物或组合物可防止不利的影响,例如腐烂(rotting)、腐败(decay)、变色、褪色或发霉的形成。

[0459] 在处理木材的情况下,本发明的化合物和组合物还可用于抵抗易于在木料(timber)上或木料内生长的真菌病害。

[0460] 木料意指所有类型的木材种类和用于建筑物的该木材的所有类型的加工品,例如实木、高密度木材、叠层木材和胶合板。此外,本发明的化合物和组合物可用于保护与海水或咸水(brackish water)接触的物体(特别是船体、筛、网、建筑物、系泊用具和信号系统)免受污染。

[0461] 本发明的化合物和组合物还可用于保护储藏物品。储藏物品理解为意指需要长期

保护的植物来源或动物来源的天然物质或天然来源的加工产品。植物来源的储藏物品,例如植物或植物部位,如茎、叶、块茎、种子、果实、谷粒,可以在刚采收时或在通过(预)干燥、润湿、粉碎、碾磨、压制或烘烤加工后进行保护。储藏物品还包括木料,包括未加工的木料(例如建筑木料、电线杆和栅栏)或成品形式的木料(例如家具)。动物来源的储藏物品为例如兽皮、皮革、毛皮和毛发。本发明的化合物和组合物可防止不利的影响,如腐烂、腐败、变色、褪色或发霉的形成。

[0462] 能够降解或改变工业材料的微生物包括例如细菌、真菌、酵母菌、藻类和粘液生物。本发明的化合物和组合物优选抵抗真菌,特别是霉菌、使木材变色的真菌和破坏木材的真菌(子囊菌纲(Ascomycetes)、担子菌纲(Basidiomycetes)、半知菌纲(Deuteromycetes)和接合菌纲(Zygomycetes)),和抵抗粘液生物和藻类。实例包括以下属的微生物:链格孢属(*Alternaria*),例如细链格孢(*Alternaria tenuis*);曲霉属(*Aspergillus*),例如黑曲霉(*Aspergillus niger*);毛壳菌属(*Chaetomium*),例如球毛壳菌(*Chaetomium globosum*);粉孢革菌属(*Coniophora*),例如单纯粉孢革菌(*Coniophora puetana*);香菇属(*Lentinus*),例如虎皮香菇(*Lentinus tigrinus*);青霉菌属(*Penicillium*),例如灰绿青霉(*Penicillium glaucum*);多孔菌属(*Polyporus*),例如变色多孔菌(*Polyporus versicolor*);短柄霉属(*Aureobasidium*),例如出芽短柄霉(*Aureobasidium pullulans*);核茎点属(*Sclerophoma*),例如*Sclerophoma pityophila*;木霉属(*Trichoderma*),例如绿色木霉(*Trichoderma viride*);蛇口壳属(*Ophiostoma* spp.)、长喙壳属(*Ceratocystis* spp.)、腐质霉属(*Humicola* spp.)、彼得壳属(*Petriella* spp.)、毛束霉属(*Trichurus* spp.)、革盖菌属(*Coriolus* spp.)、粘褶菌属种(*Gloeophyllum* spp.)、侧耳属(*Pleurotus* spp.)、卧孔菌属(*Poria* spp.)、龙介虫属(*Serpula* spp.)和干酪菌属(*Tyromyces* spp.)、孢属(*Cladosporium* spp.)、拟青霉属(*Paecilomyces* spp.)、毛霉菌属(*Mucor* spp.)、埃希氏杆菌属(*Escherichia*),例如大肠杆菌(*Escherichia coli*);假单胞杆菌属(*Pseudomonas*),例如绿脓假单胞菌(*Pseudomonas aeruginosa*);葡萄球菌属(*Staphylococcus*),例如金黄色葡萄球菌(*Staphylococcus aureus*);念珠菌属(*Candida* spp.)和酵母属(*Saccharomyces* spp.),例如酿酒酵母(*Saccharomyces cerevisiae*)。

[0463] 基于以下实施例可以进一步理解本发明教导的各方面,所述实施例不应解释为以任何方式限制本发明的教导的范围。

[0464] 实施例

[0465] 制备实施例1:1- {[(3-溴-4,5-二氯-2-噻吩基) 羰基] 氨基} 环丙烷甲酸乙酯(化合物I.03)

[0466] 步骤1:制备3-氨基-4,5-二氯噻吩-2-甲酸甲酯

[0467] 将1.35g (5.04mmol) 3-乙酰氨基-4,5-二氯噻吩-2-甲酸甲酯溶于2.1mL (25.18mmol) 37% (w/w) 的盐酸水溶液和8.2mL甲醇的混合物中。将混合物在75°C下加热3小时。将冷却的反应混合物在0°C下用30% (w/w) 的氢氧化钠溶液进行处理。所得溶液用乙酸乙酯萃取。合并的有机层用硫酸镁干燥,过滤并在减压下浓缩,得到812mg (纯度98%,收率70%) 棕色固体状的3-氨基-4,5-二氯噻吩-2-甲酸甲酯,将其直接用于下一步。LogP = 3.11. (M+H) = 226。

[0468] 步骤2:制备3-溴-4,5-二氯噻吩-2-甲酸甲酯(化合物IIa.03)

[0469] 在0℃下,向763mg (3.41mmol) 溴化铜(II)和0.53mL (纯度90%, 3.99mmol) 亚硝酸叔丁酯于10.5mL无水乙腈的溶液中分批加入600mg (纯度88%, 2.33mmol) 3-氨基-4,5-二氯噻吩-2-甲酸甲酯。在逸出气体后,将溶液在室温下搅拌18小时。反应混合物用乙酸乙酯稀释并用1M盐酸水溶液酸化。水层用乙酸乙酯萃取3次。合并的有机层用硫酸镁干燥,过滤并在减压下浓缩。残余物通过硅胶柱色谱纯化(梯度正庚烷/乙酸乙酯),得到563mg (98%纯度, 82%收率)黄色固体状的3-溴-4,5-二氯噻吩-2-甲酸甲酯。LogP=3.99. (M+H) = 288。

[0470] 步骤3:制备3-溴-4,5-二氯噻吩-2-甲酸(化合物IIa.04)

[0471] 向250mg (0.86mmol) 3-溴-4,5-二氯噻吩-2-甲酸甲酯于5mL四氢呋喃中的溶液中滴加1mL 1.9M的氢氧化钾水溶液(1.9mmol)。将反应在室温下搅拌18小时。将反应混合物用乙酸乙酯、水和饱和碳酸氢钠水溶液稀释。将有机层用饱和碳酸氢钠水溶液洗涤两次。在0℃下,将合并的水层小心地用37% (w/w) 盐酸水溶液酸化并用乙酸乙酯萃取。合并的有机层用硫酸镁干燥,过滤并在减压下浓缩,得到219mg (纯度96%, 收率88%)白色固体状的3-溴-4,5-二氯噻吩-2-甲酸。LogP=2.51. (M-H) = 273。

[0472] 步骤4:制备1- {[(3-溴-4,5-二氯-2-噻吩基) 羰基] 氨基} 环丙烷甲酸乙酯(化合物I.03)

[0473] 在惰性气氛下,在100mL圆底烧瓶中,将2.47g (14.6mmol) 2-氯-1,3-二甲基咪唑鎓氯化物溶于50mL二氯甲烷中的溶液加入3.45g (90%纯度, 11.2mmol) 3-溴-4,5-二氯噻吩-2-甲酸和8.43mL (48.3mmol) N,N-二异丙基乙胺溶于50mL二氯甲烷中的溶液中。在搅拌5分钟后,加入2.47mg (14.6mmol) 1-氨基环丙烷甲酸乙酯盐酸盐(1:1)并将反应混合物在室温下搅拌16小时。将反应混合物在减压下浓缩并将残余物通过硅胶柱色谱纯化(梯度正庚烷/乙酸乙酯),得到3.75mg (纯度100%, 收率86%)米色固体状的1- {[(3-溴-4,5-二氯-2-噻吩基) 羰基] 氨基} 环丙烷甲酸乙酯。LogP=3.44. (M+H) = 386。

[0474] 制备实施例2:1- {[(3-溴-4,5-二氯-2-噻吩基) 羰基] 氨基} 环丙烷甲酸(化合物I.15)

[0475] 向150mg (0.38mmol) 1- {[(3-溴-4,5-二氯-2-噻吩基) 羰基] 氨基} 环丙烷甲酸乙酯于2.3mL四氢呋喃中的溶液中滴加19.5mg (0.81mmol) 氢氧化锂的水溶液(0.4mL)。将反应在室温下搅拌16小时。将反应混合物用乙酸乙酯、水稀释并小心地用1M盐酸水溶液酸化至pH 1,用乙酸乙酯萃取两次。合并的有机层用硫酸镁干燥,过滤并在减压下浓缩,得到131mg (纯度100%, 收率94%)白色固体状的3-溴-4,5-二氯噻吩-2-甲酸。LogP=2.39. (M-H) = 358。

[0476] 制备实施例3:1- {[(3-溴-4,5-二氯-2-噻吩基) 羰基] 氨基} 环丙烷甲酸乙酯(化合物I.03)

[0477] 步骤1:制备3-氨基-4,5-二氯噻吩-2-甲酸(化合物XIIIa.02)

[0478] 向200mg (0.74mmol) 3-乙酰氨基-4,5-二氯噻吩-2-甲酸甲酯于1.0mL甲醇中的溶液滴加105mg (1.86mmol) 氢氧化钾水溶液(1.0mL)。将反应在室温下搅拌0.5小时,然后在85℃下加热18小时。将所得反应混合物在减压下浓缩,得到水层,其小心地用1M盐酸水溶液酸化至pH 6。过滤所得沉淀物并干燥,得到112mg (纯度96%, 收率68%)米色固体状的标题化合物。LogP=2.05. (M+H) = 212。

[0479] 步骤2:制备1- {[(3-氨基-4,5-二氯-2-噻吩基) 羰基] 氨基} 环丙烷甲酸乙酯(化合物XI.01)

[0480] 向150mg (0.60mmol) 3-氨基-4,5-二氯噻吩-2-甲酸盐酸盐(1:1)和255mg (1.50mmol) 1-氨基环丙烷甲酸乙酯盐酸盐(1:1)溶于4.0mL二氯甲烷中的溶液加入0.45mL (2.59mmol) N,N-二异丙基乙胺,然后加入255mg (1.50mmol) 2-氯-1,3-二甲基咪唑鎓氯化物于2.0mL二氯甲烷中的溶液。将反应混合物在室温下搅拌16小时。将反应混合物用水淬灭并用二氯甲烷萃取。合并的有机层用硫酸镁干燥,过滤并在减压下浓缩。残余物通过制备型高效液相色谱纯化(梯度乙腈/甲酸水溶液(1%)),得到69mg (纯度100%,收率35%)白色固体状的标题化合物。LogP=2.77. (M+H) = 323。

[0481] 步骤3:制备1- {[(3-溴-4,5-二氯-2-噻吩基) 羰基] 氨基} 环丙烷甲酸乙酯(化合物 I.03)

[0482] 在0°C下,向53mg (0.46mmol) 溴化铜(II)和61μL (纯度90%,0.46mmol) 亚硝酸叔丁酯于2mL无水乙腈中的溶液滴加100mg (0.30mmol) 1- {[(3-氨基-4,5-二氯-2-噻吩基) 羰基] 氨基} 环丙烷甲酸乙酯于2mL无水乙腈中的溶液。在逸出气体后,将溶液在室温下搅拌72小时。反应混合物用二氯甲烷稀释并用1M盐酸水溶液酸化。水层用二氯甲烷萃取2次。合并的有机层用硫酸镁干燥,过滤并在减压下浓缩。残余物通过制备型高效液相色谱纯化(梯度乙腈/甲酸的水溶液(1%)),然后通过制备型超临界流体色谱纯化(梯度CO₂/乙醇),得到30mg (纯度100%,收率25%)白色固体状的标题化合物。LogP=3.48. (M+H) = 386。

[0483] 制备实施例4:1- {[(4,5-二溴-3-氟-2-噻吩基) 羰基] 氨基} 环丙烷甲酸乙酯(化合物 I.01)

[0484] 步骤1:制备1- {[(4-溴-3-氟-2-噻吩基) 羰基] 氨基} 环丙烷甲酸乙酯(化合物 IVa.01)

[0485] 向300mg (1.33mmol) 4-溴-3-氟噻吩-2-甲酸和442mg (2.66mmol) 1-氨基环丙烷甲酸乙酯盐酸盐(1:1)溶于10mL二氯甲烷中的溶液加入1.0mL (5.73mmol) N,N-二异丙基乙胺,然后加入293mg (1.73mmol) 2-氯-1,3-二甲基咪唑鎓氯化物于1.7mL二氯甲烷中的溶液。将反应混合物在室温下搅拌18小时。将反应混合物用水淬灭并用二氯甲烷萃取。合并的有机层经Chem Elut™柱过滤并在减压下浓缩。残余物通过硅胶柱色谱纯化(梯度正庚烷/乙酸乙酯),得到315mg (纯度100%,收率70%)白色固体状的标题化合物。LogP=2.39. (M+H) = 336。

[0486] 步骤2:制备1- {[(4,5-二溴-3-氟-2-噻吩基) 羰基] 氨基} 环丙烷甲酸乙酯(化合物 I.01)

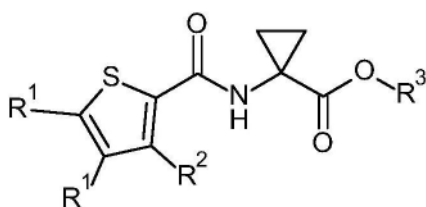
[0487] 在微波反应管中,向100mg (0.29mmol) 1- {[(4-溴-3-氟-2-噻吩基) 羰基] 氨基} 环丙烷甲酸乙酯于1mL乙酸中的搅拌悬浮液中加入92μL (1.78mmol) 溴。密封反应管并将反应混合物在70°C下搅拌2.5小时。将反应混合物冷却至室温并加入至冰和硫代硫酸钠的搅拌溶液中。将所得混合物用二氯甲烷萃取两次。合并的有机层用水洗涤,用硫酸钠干燥,过滤并在减压下浓缩。残余物通过硅胶柱色谱纯化(梯度正庚烷/乙酸乙酯),得到27mg (纯度100%,收率22%)白色固体状的标题化合物。LogP=3.13. (M+Na) = 436。

[0488] 示例性化合物

[0489] 以类似于上文提供的实施例和/或根据本文公开方法的概括性描述来制备表1、2、3、4、5和6中所示的本发明的示例性化合物。

[0490] 下表1以非限制性方式示出了根据式(I)的化合物的实例。

[0491]



(I)

[0492] 表1:

[0493]

实施例编号	R ¹	R ²	R ³	LogP
I.01	Br	F	Et	3.13 ^[a]
I.02	Br	F	H	2.19 ^[a]
I.03	Cl	Br	Et	3.45 ^[a]
I.04	Cl	I	Et	3.39 ^[a]
I.05	Cl	I	H	2.34 ^[a]
I.06	Br	I	Et	3.41 ^[a]
I.07	Br	I	Me	3.06 ^[a]
I.08	Br	I	H	2.43 ^[a]
I.09	Br	Cl	Et	3.51 ^[a]
I.10	Br	Cl	Me	3.06 ^[a]
I.11	Br	Br	Me	3.11 ^[a]
I.12	Cl	Br	Me	3.06 ^[a]
I.13	Br	Cl	H	2.41 ^[a]
I.14	Br	Br	H	2.43 ^[a]
I.15	Cl	Br	H	2.37 ^[a]
I.16	Br	F	Me	2.77 ^[a]
I.17	Br	F	苄基	3.94 ^[a]
I.18	Br	F	环戊基	3.99 ^[a]
I.19	Br	F	叔丁基	3.91 ^[a]
I.20	Br	F	2-甲基丙基	3.92 ^[a]
I.21	Br	F	丁基	3.96 ^[a]
I.22	Br	F	异丙基	3.52 ^[a]
I.23	Br	F	丙-2-炔-1-基	3.06 ^[a]
I.24	Br	F	烯丙基	3.33 ^[a]
I.25	Cl	Br	苄基	4.28 ^[a]

[0494]

实施例编号	R ¹	R ²	R ³	LogP
I.26	Cl	Br	环戊基	4.37 ^[a]
I.27	Cl	Br	叔丁基	4.30 ^[a]
I.28	Cl	Br	2-甲基丙基	4.31 ^[a]
I.29	Cl	Br	丁基	4.34 ^[a]
I.30	Cl	Br	环丁基	4.07 ^[a]
I.31	Cl	Br	丙基	3.89 ^[a]
I.32	Cl	Br	异丙基	3.86 ^[a]
I.33	Cl	Br	丙-2-炔-1-基	3.35 ^[a]
I.34	Cl	Br	烯丙基	3.66 ^[a]
I.35	Br	I	环丁基	3.99 ^[a]
I.36	Br	F	环丁基	3.71 ^[a]
I.37	Br	F	丙基	3.54 ^[a]
I.38	Br	Br	环丁基	4.10 ^[a]
I.39	Br	Br	丙基	3.92 ^[a]
I.40	Br	Cl	丙基	3.91 ^[a]
I.41	Br	I	丙基	3.85 ^[a]
I.42	Br	Cl	环丁基	4.17 ^[a]
I.43	Br	Br	Et	3.51 ^[a]
I.44	Cl	F	Et	3.05 ^[a]
I.45	Cl	F	Me	2.65 ^[a]
I.46	Cl	Br	环丙基甲基	4.05 ^[a]
I.47	Br	Br	丙-2-炔-1-基	3.44 ^[a]
I.48	Br	Br	烯丙基	3.77 ^[a]
I.49	Br	Br	叔丁基	4.40 ^[a]
I.50	Br	Br	苜基	4.37 ^[a]
I.51	Br	I	丙-2-炔-1-基	3.40 ^[a]
I.52	Br	I	烯丙基	3.71 ^[a]

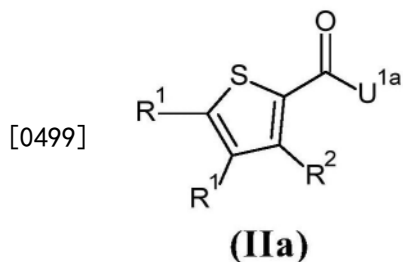
实施例编号	R ¹	R ²	R ³	LogP
I.53	Br	I	叔丁基	4.30 ^[a]
I.54	Br	I	苄基	4.30 ^[a]
I.55	Br	Br	环戊基	4.47 ^[a]
I.56	Br	Br	2-甲基丙基	4.40 ^[a]
I.57	Br	Br	丁基	4.44 ^[a]
I.58	Br	Br	异丙基	3.98 ^[a]
I.59	Br	I	环戊基	4.37 ^[a]
I.60	Br	I	2-甲基丙基	4.33 ^[a]
I.61	Br	I	丁基	4.33 ^[a]
I.62	Br	I	异丙基	3.87 ^[a]
I.63	Cl	Br	氟基甲基	3.06 ^[a]
I.64	Cl	Br	2,2,2-三氟乙基	3.91 ^[a]
I.65	Cl	Br	三甲基硅基甲基	5.00 ^[a]
I.66	Cl	Br	苯基	4.19 ^[a]
I.67	Br	Br	环丙基甲基	4.02 ^[a]
I.68	Br	Br	氧杂环己烷-4-基	3.26 ^[a]
I.69	Br	Br	三甲基硅基甲基	4.97 ^[a]
I.70	Cl	Br	氧杂环己烷-4-基	3.23 ^[a]
I.71	Cl	Br	硫杂环丁烷-3-基	3.87 ^[a]
I.72	Br	Br	氟基甲基	3.16 ^[a]
I.73	Br	Br	苯基	4.23 ^[a]
I.74	Br	Br	2,2,2-三氟乙基	3.94 ^[a]
I.75	Br	Br	硫杂环丁烷-3-基	4.85 ^[a]

[0495]

[0496] 注:Me:甲基,Et:乙基

[0497] 以类似于上文提供的实施例和/或根据本文公开方法的概括性描述来制备下表所示的本发明的示例性中间体。

[0498] 下表2以非限制性方式示出了根据式(IIa)的中间体的实施例。



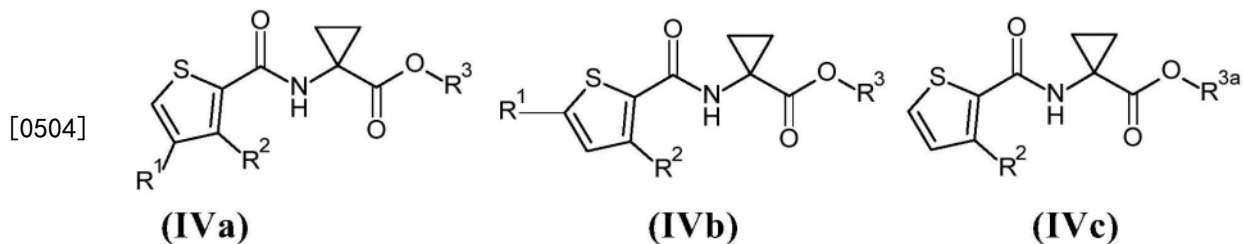
[0500] 表2:

[0501]

实施例编号	R ¹	R ²	U ^{1a}	LogP
II.a.01	Br	F	2-甲基丙氧基	5.31 ^[a]
II.a.02	Cl	I	OEt	4.73 ^[b]
II.a.03	Cl	Br	OMe	4.11 ^[a]
II.a.04	Cl	Br	OH	2.52 ^[a]
II.a.05	Br	I	OMe	4.20 ^[a]
II.a.06	Cl	I	OMe	4.15 ^[a]
II.a.07	Cl	I	OH	2.64 ^[a]
II.a.08	Br	I	OEt	4.78 ^[a]
II.a.09	Cl	Br	OEt	4.58 ^[a]

[0502] 注:Me:甲基,Et:乙基

[0503] 下表3以非限制性方式示出了根据式(IVa)、(IVb)和(IVc)的中间体的实施例。



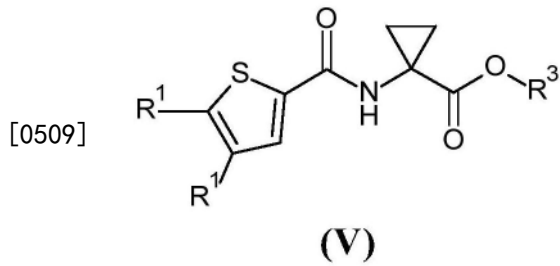
[0505] 表3:

[0506]

实施例编号	R ¹	R ²	R ³	R ^{3a}	LogP
IVa.01	Br	F	Et	-	2.37 ^[a]
IVb.01	Br	Cl	Et	-	2.84 ^[a]
IVb.02	Br	I	Et	-	2.98 ^[a]
IVb.03	Br	F	Et	-	2.46 ^[a]
IVb.04	Cl	Br	Et	-	2.86 ^[a]
IVb.05	Br	Br	Et	-	2.92 ^[a]
IVc.01	-	F	-	Et	1.65 ^[a]

[0507] 注:Et:乙基

[0508] 下表4以非限制性方式示出了根据式(V)的中间体的实施例。



[0510] 表4:

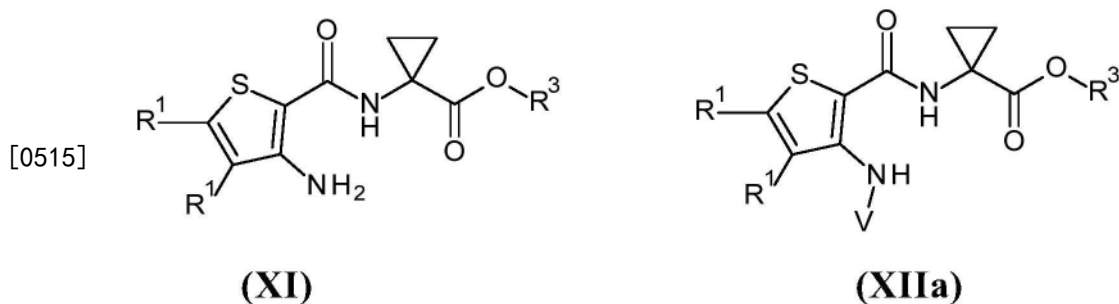
实施例编号	R ¹	R ³	LogP
V.01	Br	Et	2.90 ^[a]
V.02	Br	异丙基	3.25 ^[a]
V.03	Cl	Et	2.77 ^[a]
V.04	Cl	Me	2.49 ^[a]

[0511]

实施例编号	R ¹	R ³	LogP
V.05	Cl	H	2.01 ^[a]

[0512] 注:Me:甲基,Et:乙基

[0513] 下表5以非限制性方式示出了根据式(XI)和(XIIa)的中间体的实施例。



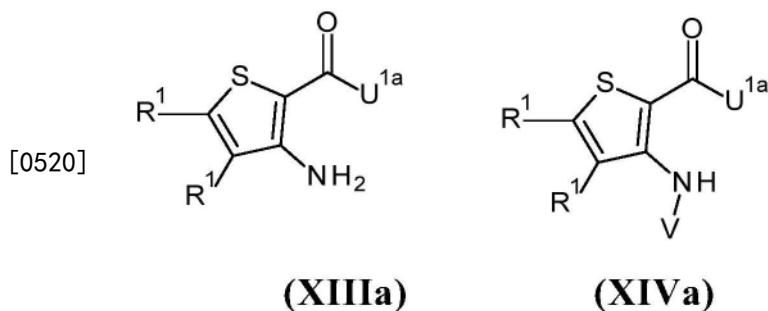
[0515] 表5:

[0516]

实施例编号	R ¹	R ³	V	LogP
XI.01	Cl	Et		2.77 ^[a]
XIIa.01	Cl	Et	叔丁氧基羰基	3.34 ^[a]

[0517] 注:Et:乙基

[0518] 下表6以非限制性方式示出了根据式(XIVa)的中间体的实施例。



[0521] 表6:

实施例编号	R ¹	U ^{1a}	V	LogP
XIIIa.01	Br	OMe		3.15 ^[a]
XIIIa.02	Cl	OH		2.05 ^[a]
XIVa.01	Br	OMe	乙酰基	2.01 ^[a]

[0523]

实施例编号	R ¹	U ^{1a}	V	LogP
XIVa.02	Br	OH	乙酰基	1.39 ^[a]

[0524] 注:Me:甲基,乙酰基:-C(=O)-CH₃

[0525] 在上表中,根据EEC directive 79/831Annex V.A8,通过HPLC(高效液相色谱)在反相柱上使用下述方法进行LogP值的测量:

[0526] ^[a]LogP值通过在酸性范围内使用0.1%甲酸水溶液和乙腈作为洗脱液(线性梯度为10%乙腈至95%乙腈)进行LC-UV测量而确定。

[0527] ^[b]LogP值通过在中性范围内使用0.001摩尔乙酸铵水溶液和乙腈作为洗脱液(线性梯度为10%乙腈至95%乙腈)进行LC-UV测量而确定。

[0528] ^[c]LogP值通过在酸性范围内使用0.1%磷酸和乙腈作为洗脱液(线性梯度为10%乙腈至95%乙腈)进行LC-UV测量而确定。

[0529] 如果在同一方法内,可获得多于一个LogP值,则示出所有的值并且以“+”分开。

[0530] 使用具有已知LogP值的直链烷-2-酮(具有3至16个碳原子)进行校准(LogP值的测量通过在连续的烷酮之间的线性内插法使用保留时间进行)。使用200nm至400nm的UV光谱和色谱信号的峰值测定 λ_{\max} 值。

[0531] NMR-峰列表

[0532] 表A提供了上表所公开的一些化合物的NMR数据(¹H)。

[0533] 所选实施例的¹H-NMR数据以¹H-NMR峰列表的形式示出。对于各信号峰,列出了以ppm计的 δ 值,并且在圆括号内列出了信号强度。在 δ 值-信号强度数对之间以分号分隔列出。

[0534] 因此,一个实例的峰值列表采用以下形式:

[0535] δ_1 (强度₁); δ_2 (强度₂);.....; δ_i (强度_i);.....; δ_n (强度_n)

[0536] 尖锐信号的强度与以厘米计的NMR光谱的打印实例的信号的高度相关,并且示出信号强度的真实关系。由宽信号可以示出多个峰或信号中部以及其与光谱中最强信号相比的相对强度。

[0537] 为校准¹H谱的化学位移,利用四甲基硅烷和/或所用溶剂的化学位移,特别是在DMSO中测量的光谱的情况下。因此,在NMR峰列表中,四甲基硅烷峰可以但不是必需出现。

[0538] ¹H-NMR峰的列表类似于常规¹H-NMR打印件,因此,其通常含有以常规NMR说明列出的所有峰。

[0539] 另外,如同常规¹H-NMR打印件,其可显示出溶剂信号、目标化合物的立体异构体(其也是本发明的主题)的信号和/或杂质峰的信号。

[0540] 为了示出在溶剂和/或水的 δ 范围内的化合物信号,溶剂的常规峰,例如在DMSO-D₆

中的DMSO的峰和水的峰示于¹H-NMR峰列表中,并且通常具有平均的高强度。

[0541] 目标化合物的立体异构体的峰和/或杂质的峰通常具有比目标化合物(例如具有>90%的纯度)的峰平均更低的强度。

[0542] 这些立体异构体和/或杂质对于特定制备方法可以是典型的。因此,它们的峰可借助“副产品指纹图谱”帮助识别制备方法的再现性。

[0543] 技术人员在使用已知方法(MestreC,ACD模拟,以及利用凭经验评估的预期值)计算目标化合物的峰时,可以任选地使用附加的强度滤波器按照需要分离出目标化合物的峰。这种分离类似于常规¹H-NMR说明中相关峰的拾取。

[0544] 带有峰列表的NMR数据说明的其他详情可见于研究公开数据库第564025号(Research Disclosure Database Number 564025)的出版物“Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications”。

[0545] 表A:NMR峰列表

[0546]

I.01: ¹H-NMR(300.2 MHz, CDCl₃): δ= 7.2986 (10.0); 6.7692 (0.9); 6.7458 (1.0); 4.2374 (2.3); 4.2136 (7.4); 4.1898 (7.5); 4.1661 (2.5); 2.0459 (0.3); 1.7222 (2.0); 1.7054 (5.5); 1.6946 (5.6); 1.6792 (2.5); 1.6057 (11.6); 1.3404 (2.6); 1.3250 (5.7); 1.3142 (5.8); 1.2927 (8.4); 1.2690 (16.0); 1.2452 (7.7); 0.0464 (0.4); 0.0356 (12.6); 0.0246 (0.4)
I.02: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.6811 (9.2); 8.2115 (1.4); 3.6200 (0.3); 3.5087 (0.6); 3.4532 (0.7); 3.4350 (0.7); 3.3804 (0.8); 3.3674 (0.8); 3.3592 (0.8); 3.2641 (0.7); 3.1691 (0.8); 2.5129 (16.4); 2.5086 (33.1); 2.5041 (44.1); 2.4996 (31.6); 2.4953 (15.0); 2.0770 (1.6); 1.3876 (5.8); 1.3757 (14.5); 1.3676 (16.0); 1.3571 (6.8); 1.3178 (0.6); 1.1827 (0.6); 1.1756 (0.4); 1.1432 (7.2); 1.1326 (15.7); 1.1245 (15.0); 1.1126 (5.6); 0.0000 (1.2)
I.03: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0297 (2.9); 4.1005 (2.1); 4.0828 (6.7); 4.0651 (6.7); 4.0473 (2.1); 3.3285 (11.9); 2.5220 (0.4); 2.5133 (6.0); 2.5088 (12.5); 2.5042 (16.6); 2.4995 (12.0); 2.4950 (5.9); 1.4637 (1.8); 1.4515 (4.4); 1.4431 (4.8); 1.4322 (2.0); 1.1946 (2.2); 1.1820 (10.0); 1.1753 (4.9); 1.1641 (16.0); 1.1463 (7.1); -0.0002 (0.4)

[0547]

<p>I.04: ¹H-NMR(499.9 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.1058 (3.8); 4.1569 (2.1); 4.1426 (6.5); 4.1284 (6.6); 4.1143 (2.1); 3.3757 (1.0); 2.5650 (0.4); 2.5615 (0.8); 2.5579 (1.0); 2.5543 (0.8); 2.5508 (0.4); 1.5126 (1.8); 1.5030 (4.7); 1.4964 (5.0); 1.4875 (2.0); 1.2481 (7.1); 1.2338 (16.0); 1.2238 (5.6); 1.2196 (9.1); 1.2076 (1.9)</p>
<p>I.05: ¹H-NMR(300.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 12.5912 (0.3); 12.5704 (0.3); 8.9622 (5.6); 3.3582 (16.0); 2.5348 (7.3); 2.5289 (15.6); 2.5228 (21.8); 2.5167 (15.8); 2.5108 (7.3); 1.4582 (2.0); 1.4422 (5.0); 1.4314 (5.7); 1.4172 (2.5); 1.1587 (2.6); 1.1445 (5.5); 1.1336 (5.4); 1.1178 (2.0); 0.0317 (1.0); 0.0207 (30.4); 0.0098 (1.1)</p>
<p>I.06: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0605 (4.1); 8.3150 (0.5); 4.1032 (2.2); 4.0855 (7.1); 4.0677 (7.1); 4.0500 (2.3); 3.3287 (15.8); 2.8923 (0.7); 2.7326 (0.6); 2.5263 (0.4); 2.5216 (0.6); 2.5128 (8.7); 2.5084 (18.0); 2.5038 (23.9); 2.4992 (17.7); 2.4948 (8.9); 1.4546 (1.8); 1.4425 (4.6); 1.4343 (5.1); 1.4233 (2.1); 1.1961 (7.7); 1.1783 (16.0); 1.1693 (2.6); 1.1604 (9.6); 1.1499 (5.1); 1.1378 (1.8); -0.0002 (0.5)</p>
<p>I.07: ¹H-NMR(300.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0801 (2.6); 3.6446 (16.0); 3.3477 (11.1); 2.5279 (2.3); 2.5220 (3.1); 2.5161 (2.2); 1.4960 (1.0); 1.4795 (2.8); 1.4685 (3.1); 1.4541 (1.3); 1.2106 (1.4); 1.1961 (3.1); 1.1851 (2.9); 1.1685 (1.1); 0.0189 (2.7)</p>
<p>I.08: ¹H-NMR(300.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 12.6292 (0.5); 12.5891 (0.6); 12.5706 (0.6); 12.5368 (0.5); 8.9512 (15.1); 6.8906 (0.3); 3.3471 (16.0); 2.5343 (14.3); 2.5283 (29.9); 2.5222 (40.7); 2.5161 (28.9); 2.5102 (13.1); 2.2042 (0.5); 2.0093 (1.1); 1.9289 (0.4); 1.4951 (0.3); 1.4457 (5.1); 1.4297 (12.6); 1.4189 (14.1); 1.4050 (6.2); 1.3753 (4.2); 1.3509 (0.6); 1.2561 (0.6); 1.2184 (0.5); 1.2012 (1.5); 1.1949 (1.1); 1.1708 (0.7); 1.1518 (6.7); 1.1379 (14.3); 1.1271 (13.5); 1.1112 (5.0); 0.0308 (1.6); 0.0200 (45.4); 0.0090 (1.5)</p>
<p>I.09: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.9370 (2.9); 8.3118 (0.8); 4.0946 (2.2); 4.0769 (7.2); 4.0592 (7.3); 4.0414 (2.3); 3.3293 (20.0); 2.5272 (0.4); 2.5224 (0.6); 2.5138 (8.8); 2.5093 (18.0); 2.5047 (23.6); 2.5001 (16.8); 2.4956 (8.0); 1.4601 (1.8); 1.4478 (4.6); 1.4395 (5.0); 1.4285 (2.1); 1.1997 (2.3); 1.1887 (4.9); 1.1803 (4.9); 1.1726 (8.1); 1.1682 (2.2); 1.1549 (16.0); 1.1371 (7.5); -0.0002 (1.1)</p>
<p>I.10: ¹H-NMR(300.2 MHz, CDCl₃): δ= 7.4278 (0.8); 7.2987 (6.4); 5.3380 (0.4); 3.7510 (16.0); 1.7477 (1.0); 1.7308 (2.9); 1.7200 (2.9); 1.7045 (1.3); 1.5918 (2.3); 1.3759 (1.3); 1.3604 (2.9); 1.3496 (2.9); 1.3327 (1.0); 0.0366 (8.1)</p>
<p>I.11: ¹H-NMR(300.2 MHz, CDCl₃): δ= 7.5803 (1.0); 7.2984 (4.3); 3.7517 (16.0); 1.7458 (1.1); 1.7289 (3.1); 1.7181 (3.2); 1.7027 (1.4); 1.5994 (1.5); 1.3788 (1.4); 1.3634 (3.2); 1.3526 (3.2); 1.3356 (1.2); 0.0357 (5.6)</p>
<p>I.12: ¹H-NMR(300.2 MHz, CDCl₃): δ= 7.5601 (1.2); 7.3006 (3.1); 7.2980 (3.7); 7.2901 (1.0); 3.7551 (13.6); 3.7527 (16.0); 3.7448 (4.5); 1.7476 (1.1); 1.7309 (3.3); 1.7206 (4.0); 1.7117 (1.2); 1.7047 (1.6); 1.6963 (0.5); 1.6041 (1.8); 1.6015 (2.1); 1.5936 (0.6); 1.3815 (1.4); 1.3669 (3.5); 1.3565 (3.9); 1.3472 (1.2); 1.3403 (1.3); 1.3385 (1.3); 1.3304 (0.4); 0.0376 (4.0); 0.0349 (4.9); 0.0270 (1.4)</p>
<p>I.13: ¹H-NMR(300.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 12.5766 (1.5); 8.8300 (3.7); 3.3459 (16.0); 2.5276 (8.8); 2.5217 (11.9); 2.5158 (8.8); 2.0084 (0.8); 1.4514 (1.4); 1.4350 (3.6); 1.4243 (4.0); 1.4102 (1.7); 1.1940 (0.5); 1.1760 (1.8); 1.1617 (3.8); 1.1509 (3.7); 1.1348 (1.4); 0.0297 (0.4); 0.0190 (8.8); 0.0081 (0.4)</p>
<p>I.14: ¹H-NMR(300.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 12.5829 (1.4); 8.9016 (2.9); 3.3458 (16.0); 2.5336 (4.3); 2.5278 (8.8); 2.5218 (11.9); 2.5157 (8.7); 2.5099 (4.2); 2.0088 (0.5); 1.4513 (1.1); 1.4350 (2.6); 1.4244 (3.0); 1.4103 (1.3); 1.1942 (0.4); 1.1624 (1.4); 1.1480 (3.0); 1.1374 (2.8); 1.1211 (1.1); 0.0304 (0.4); 0.0195 (11.3); 0.0085 (0.4)</p>
<p>I.15: ¹H-NMR(300.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 12.6626 (0.4); 12.6476 (0.4); 12.6242 (0.4); 12.5754 (0.4); 8.9164 (14.6); 4.0605 (0.6); 4.0368 (0.6); 3.3516 (4.4); 3.1902 (0.4); 2.5339 (12.4); 2.5280 (26.2); 2.5219 (35.8); 2.5158 (26.0); 2.5098 (12.2); 2.0090 (2.4); 1.9284 (2.2); 1.4449 (5.5); 1.4288 (14.0); 1.4179 (16.0); 1.4041 (7.1); 1.3511 (0.6); 1.3028 (0.5); 1.2812 (0.6); 1.2607 (0.6); 1.2382 (0.7); 1.2281 (0.8); 1.2181 (1.0); 1.2002 (0.9); 1.1944 (1.9); 1.1758 (7.4); 1.1618 (15.8); 1.1509 (14.7); 1.1348 (5.7); 1.0843 (0.4); 0.0304 (1.3); 0.0195 (37.9); 0.0085 (1.5)</p>

[0548]

<p>I.16: ¹H-NMR(300.2 MHz, CDCl₃): δ= 7.2989 (0.5); 6.8148 (0.6); 6.7916 (0.6); 4.1302 (0.3); 3.7323 (16.0); 2.0677 (1.4); 1.7485 (0.3); 1.7162 (1.1); 1.6993 (3.0); 1.6885 (3.0); 1.6730 (1.3); 1.3363 (1.4); 1.3208 (3.0); 1.3100 (3.1); 1.2931 (1.2); 1.2817 (0.8); 1.2578 (0.4); 0.0212 (0.7)</p>
<p>I.17: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.8909 (4.5); 7.9547 (0.3); 7.3701 (1.3); 7.3652 (1.2); 7.3499 (4.4); 7.3353 (10.1); 7.3237 (15.1); 7.3124 (3.8); 7.3057 (4.6); 7.2940 (0.9); 7.2890 (0.8); 5.1153 (16.0); 3.3640 (0.8); 3.3403 (45.6); 2.8925 (2.0); 2.7339 (1.9); 2.5090 (23.1); 2.5049 (29.3); 2.5010 (23.4); 1.4989 (2.3); 1.4865 (5.9); 1.4784 (6.6); 1.4674 (2.7); 1.2439 (3.0); 1.2328 (6.5); 1.2247 (6.2); 1.2122 (2.2); -0.0002 (0.6)</p>
<p>I.18: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.8138 (9.9); 7.9545 (0.5); 5.0663 (3.3); 5.0525 (6.2); 5.0383 (3.3); 4.0154 (0.4); 3.3355 (69.9); 2.8937 (3.7); 2.7341 (3.2); 2.6742 (0.4); 2.5138 (26.1); 2.5097 (48.7); 2.5053 (62.0); 2.5008 (46.2); 2.4966 (23.5); 2.3321 (0.4); 1.7582 (5.2); 1.7445 (5.4); 1.7324 (3.3); 1.7256 (3.8); 1.6064 (1.2); 1.5704 (14.0); 1.5574 (13.7); 1.5512 (14.4); 1.5397 (15.1); 1.5194 (6.4); 1.5100 (4.8); 1.4488 (0.3); 1.4276 (0.4); 1.4107 (5.7); 1.3984 (14.6); 1.3902 (16.0); 1.3793 (6.9); 1.3581 (0.6); 1.3395 (0.6); 1.2380 (1.1); 1.2079 (0.6); 1.1884 (0.4); 1.1683 (7.1); 1.1572 (15.4); 1.1490 (14.8); 1.1367 (5.5); 0.8673 (0.4); 0.8491 (0.7); -0.0002 (1.8)</p>
<p>I.19: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.7382 (0.9); 3.3348 (7.5); 2.8936 (0.8); 2.7341 (0.7); 2.5135 (2.5); 2.5094 (4.9); 2.5050 (6.3); 2.5006 (4.8); 1.3882 (0.6); 1.3761 (1.6); 1.3673 (2.4); 1.3580 (16.0); 1.1269 (0.6); 1.1160 (1.5); 1.1079 (1.4); 1.0957 (0.5)</p>
<p>I.20: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.8486 (2.2); 3.8201 (5.6); 3.8043 (5.6); 3.3352 (14.5); 2.8935 (0.5); 2.7337 (0.4); 2.5095 (10.7); 2.5051 (13.9); 2.5007 (10.9); 1.8507 (0.5); 1.8342 (1.0); 1.8177 (1.2); 1.8011 (1.0); 1.7847 (0.5); 1.4463 (1.2); 1.4339 (3.2); 1.4256 (3.5); 1.4148 (1.5); 1.2105 (1.5); 1.1994 (3.4); 1.1912 (3.3); 1.1788 (1.2); 0.8517 (16.0); 0.8348 (15.4); -0.0002 (0.4)</p>
<p>I.21: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.8241 (3.8); 4.0313 (4.5); 4.0153 (9.1); 3.9993 (4.5); 3.3361 (30.6); 2.8934 (0.8); 2.7344 (0.6); 2.5133 (10.7); 2.5094 (19.3); 2.5049 (24.0); 2.5004 (17.5); 2.4962 (8.6); 1.5346 (0.9); 1.5181 (2.9); 1.5111 (1.2); 1.5014 (3.8); 1.4811 (3.3); 1.4653 (1.3); 1.4402 (2.2); 1.4279 (5.6); 1.4197 (6.0); 1.4087 (2.6); 1.3338 (0.6); 1.3152 (2.4); 1.2962 (3.8); 1.2774 (3.7); 1.2592 (2.2); 1.2407 (1.1); 1.1991 (2.7); 1.1881 (5.9); 1.1799 (5.6); 1.1674 (2.0); 0.8672 (8.2); 0.8488 (16.0); 0.8303 (7.0); -0.0002 (0.5)</p>
<p>I.22: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.7943 (2.1); 4.8803 (0.4); 4.8648 (1.2); 4.8492 (1.6); 4.8336 (1.2); 4.8180 (0.5); 3.3346 (14.2); 2.8933 (0.5); 2.7335 (0.5); 2.5092 (9.6); 2.5049 (12.5); 2.5005 (9.7); 1.4276 (1.2); 1.4152 (3.1); 1.4071 (3.4); 1.3961 (1.4); 1.1765 (1.5); 1.1654 (3.5); 1.1568 (4.0); 1.1495 (16.0); 1.1338 (15.5); -0.0002 (0.4)</p>
<p>I.23: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.8683 (6.0); 7.9532 (1.0); 4.7109 (15.5); 4.7049 (16.0); 3.5563 (3.9); 3.5504 (7.9); 3.5444 (3.9); 3.3357 (40.7); 2.8931 (6.8); 2.7332 (6.0); 2.5092 (26.5); 2.5048 (34.7); 2.5004 (27.3); 1.4878 (3.0); 1.4750 (8.0); 1.4668 (9.0); 1.4558 (3.8); 1.4158 (0.3); 1.2946 (0.3); 1.2551 (3.9); 1.2437 (8.8); 1.2356 (8.8); 1.2229 (3.1); -0.0002 (1.2)</p>
<p>I.24: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.8619 (9.8); 5.9102 (1.5); 5.8977 (3.2); 5.8845 (2.8); 5.8711 (3.8); 5.8675 (2.3); 5.8585 (2.2); 5.8546 (4.0); 5.8414 (3.2); 5.8281 (4.0); 5.8156 (2.0); 5.3004 (2.6); 5.2965 (6.8); 5.2923 (7.1); 5.2572 (2.3); 5.2533 (5.9); 5.2492 (6.1); 5.1924 (7.1); 5.1888 (7.0); 5.1660 (6.5); 5.1623 (6.5); 4.5721 (9.5); 4.5685 (15.8); 4.5649 (10.8); 4.5599 (10.6); 4.5560 (15.7); 3.3373 (77.4); 2.8935 (0.8); 2.7340 (0.7); 2.6740 (0.4); 2.5273 (1.0); 2.5094 (44.6); 2.5050 (57.9); 2.5007 (44.5); 2.3320 (0.4); 1.4793 (5.4); 1.4669 (14.4); 1.4586 (16.0); 1.4476 (6.8); 1.4078 (0.6); 1.2739 (0.7); 1.2345 (7.6); 1.2233 (15.3); 1.2150 (14.9); 1.2026 (5.4); -0.0002 (1.6)</p>

[0549]

<p>I.25: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.1100 (5.0); 7.9531 (0.5); 7.3885 (0.8); 7.3853 (1.0); 7.3814 (0.6); 7.3642 (3.4); 7.3507 (16.0); 7.3475 (12.5); 7.3354 (4.2); 7.3318 (3.7); 7.3227 (1.4); 7.3142 (2.0); 7.3047 (0.7); 7.2988 (0.6); 5.1218 (15.4); 3.3338 (90.0); 2.8910 (3.3); 2.7317 (2.8); 2.6755 (0.4); 2.6717 (0.5); 2.5454 (0.3); 2.5249 (1.5); 2.5070 (59.0); 2.5026 (74.4); 2.4982 (55.2); 2.3296 (0.4); 2.3255 (0.3); 1.5112 (2.1); 1.4988 (5.4); 1.4907 (5.9); 1.4796 (2.4); 1.2748 (0.3); 1.2586 (0.4); 1.2350 (3.0); 1.2238 (5.9); 1.2156 (5.7); 1.2032 (2.1); -0.0002 (1.7)</p>
<p>I.26: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0283 (8.2); 8.3170 (16.0); 5.0874 (2.6); 5.0738 (5.1); 5.0651 (2.2); 5.0596 (2.6); 3.3357 (51.0); 3.3119 (7.0); 2.8929 (0.8); 2.7332 (0.7); 2.5267 (0.9); 2.5089 (39.2); 2.5045 (51.3); 2.5000 (39.3); 2.3312 (0.3); 1.7732 (4.4); 1.7597 (4.0); 1.7464 (2.9); 1.7402 (3.1); 1.7326 (2.3); 1.6570 (0.4); 1.6041 (12.3); 1.5947 (7.7); 1.5893 (7.0); 1.5738 (7.5); 1.5626 (5.5); 1.5272 (4.6); 1.5118 (2.4); 1.4854 (0.4); 1.4259 (4.6); 1.4137 (12.1); 1.4054 (13.4); 1.3946 (5.7); 1.3546 (0.5); 1.2385 (0.7); 1.2048 (0.4); 1.1650 (5.2); 1.1540 (12.1); 1.1458 (11.8); 1.1336 (4.3); -0.0002 (1.3)</p>
<p>I.27: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.9647 (1.0); 8.3172 (0.8); 3.3335 (7.9); 3.3097 (0.4); 2.5084 (5.6); 2.5040 (7.2); 2.4996 (5.4); 1.3979 (0.7); 1.3799 (16.0); 1.3678 (1.2); 1.1212 (0.6); 1.1103 (1.4); 1.1022 (1.3); 1.0901 (0.5)</p>
<p>I.28: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0520 (2.7); 8.3171 (1.4); 3.8353 (5.5); 3.8194 (5.5); 3.3332 (14.2); 3.3094 (0.7); 2.5084 (11.7); 2.5042 (14.8); 2.5000 (11.6); 1.8772 (0.5); 1.8607 (1.0); 1.8441 (1.3); 1.8276 (1.0); 1.8111 (0.5); 1.4642 (1.3); 1.4519 (3.4); 1.4438 (3.7); 1.4329 (1.5); 1.2073 (1.6); 1.1963 (3.6); 1.1881 (3.5); 1.1759 (1.2); 0.8744 (16.0); 0.8575 (15.3); -0.0002 (0.4)</p>
<p>I.29: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0428 (4.7); 4.0456 (4.5); 4.0297 (9.1); 4.0137 (4.5); 3.3335 (31.7); 2.5083 (23.9); 2.5039 (30.4); 2.4994 (22.7); 1.5587 (0.9); 1.5421 (2.8); 1.5350 (1.2); 1.5255 (3.7); 1.5207 (2.8); 1.5052 (3.2); 1.4894 (1.3); 1.4557 (2.2); 1.4434 (5.8); 1.4352 (6.3); 1.4243 (2.6); 1.3593 (0.7); 1.3407 (2.3); 1.3217 (3.7); 1.3029 (3.7); 1.2847 (2.2); 1.2665 (0.6); 1.2353 (0.5); 1.1949 (2.7); 1.1839 (6.2); 1.1757 (6.0); 1.1634 (2.2); 0.8804 (8.2); 0.8620 (16.0); 0.8436 (7.0); -0.0002 (0.9)</p>
<p>I.30: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0439 (12.4); 8.3171 (0.9); 4.9371 (1.2); 4.9190 (4.6); 4.9005 (6.8); 4.8820 (4.6); 4.8639 (1.2); 3.3339 (75.1); 3.3103 (0.6); 2.8924 (1.8); 2.7329 (1.5); 2.6731 (0.4); 2.5258 (1.2); 2.5125 (25.8); 2.5083 (48.8); 2.5039 (62.3); 2.4994 (46.0); 2.4951 (22.9); 2.3307 (0.4); 2.2868 (1.8); 2.2802 (2.7); 2.2725 (2.4); 2.2670 (3.8); 2.2607 (5.2); 2.2564 (5.4); 2.2496 (5.0); 2.2426 (5.5); 2.2368 (5.9); 2.2320 (4.6); 2.2264 (3.0); 2.2188 (3.3); 2.2125 (2.5); 2.0102 (1.4); 2.0034 (1.1); 1.9897 (2.9); 1.9852 (5.5); 1.9785 (3.7); 1.9658 (5.6); 1.9602 (6.5); 1.9547 (5.0); 1.9419 (4.3); 1.9354 (5.2); 1.9177 (1.5); 1.9110 (1.6); 1.7708 (0.8); 1.7652 (1.4); 1.7594 (0.9); 1.7393 (3.7); 1.7332 (2.1); 1.7198 (2.1); 1.7140 (3.6); 1.6946 (0.8); 1.6888 (1.3); 1.6832 (0.7); 1.6326 (1.1); 1.6124 (2.3); 1.6071 (2.3); 1.5870 (4.7); 1.5820 (2.6); 1.5658 (2.5); 1.5610 (3.9); 1.5411 (1.8); 1.5355 (1.4); 1.5152 (0.6); 1.4531 (5.7); 1.4408 (14.8); 1.4326 (16.0); 1.4216 (6.6); 1.3817 (0.6); 1.2380 (1.0); 1.2269 (0.7); 1.1866 (6.9); 1.1755 (15.5); 1.1673 (14.9); 1.1550 (5.4); -0.0002 (1.8)</p>
<p>I.31: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0451 (4.3); 8.3168 (0.9); 4.0055 (4.8); 3.9895 (10.0); 3.9734 (4.9); 3.3349 (36.5); 3.3110 (0.6); 2.5122 (13.2); 2.5081 (24.6); 2.5036 (31.4); 2.4991 (23.3); 2.4949 (11.8); 1.6014 (0.6); 1.5832 (2.2); 1.5666 (4.4); 1.5485 (4.6); 1.5318 (2.4); 1.5139 (0.6); 1.4617 (2.2); 1.4495 (5.8); 1.4412 (6.3); 1.4303 (2.6); 1.2386 (0.6); 1.1989 (2.7); 1.1879 (6.2); 1.1796 (5.9); 1.1674 (2.2); 0.8847 (8.1); 0.8663 (16.0); 0.8477 (7.3); -0.0002 (0.8)</p>
<p>I.32: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0342 (2.3); 4.8971 (0.4); 4.8816 (1.1); 4.8660 (1.5); 4.8504 (1.1); 4.8348 (0.4); 3.3320 (24.4); 2.8920 (0.8); 2.7325 (0.7); 2.5075 (18.3); 2.5032 (23.4); 2.4990 (17.9); 1.4371 (1.1); 1.4250 (2.9); 1.4168 (3.2); 1.4059 (1.3); 1.1708 (15.4); 1.1553 (16.0); 1.1379 (1.2); -0.0002 (0.6)</p>

[0550]

<p>I.33: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0877 (7.0); 8.3153 (3.0); 4.7238 (15.8); 4.7178 (16.0); 3.5684 (3.8); 3.5626 (7.5); 3.5566 (3.8); 3.3345 (27.7); 3.3106 (1.4); 2.8928 (0.8); 2.7334 (0.7); 2.5085 (24.4); 2.5041 (31.4); 2.4998 (23.8); 1.5042 (3.3); 1.4917 (8.7); 1.4834 (9.5); 1.4723 (4.0); 1.4325 (0.3); 1.2914 (0.3); 1.2517 (4.2); 1.2405 (9.4); 1.2323 (9.2); 1.2197 (3.3); -0.0002 (0.8)</p>
<p>I.34: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0748 (4.4); 8.3166 (16.0); 5.9275 (0.8); 5.9149 (1.8); 5.9015 (1.6); 5.8884 (2.1); 5.8846 (1.4); 5.8756 (1.3); 5.8718 (2.3); 5.8584 (1.9); 5.8453 (2.2); 5.8327 (1.1); 5.3238 (4.0); 5.3196 (4.1); 5.3155 (1.8); 5.2806 (3.4); 5.2764 (3.6); 5.2724 (1.6); 5.2071 (4.0); 5.2034 (4.0); 5.1807 (3.7); 5.1770 (3.7); 4.5845 (5.7); 4.5810 (9.2); 4.5772 (6.5); 4.5723 (6.4); 4.5684 (9.0); 4.5648 (5.7); 3.3339 (17.6); 3.3103 (5.7); 2.8925 (1.2); 2.7329 (1.0); 2.5083 (26.6); 2.5040 (33.8); 2.4996 (26.1); 1.4951 (3.3); 1.4827 (8.7); 1.4745 (9.4); 1.4635 (4.0); 1.4236 (0.3); 1.2703 (0.4); 1.2305 (4.1); 1.2194 (9.0); 1.2112 (8.8); 1.1988 (3.2); -0.0002 (1.0)</p>
<p>I.35: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.5189 (0.4); 7.3862 (6.5); 7.2981 (0.3); 7.2601 (66.7); 6.9969 (0.4); 5.0451 (1.1); 5.0270 (4.0); 5.0084 (5.9); 4.9897 (4.0); 4.9708 (1.1); 2.3648 (1.8); 2.3582 (2.5); 2.3378 (5.4); 2.3342 (5.5); 2.3271 (5.1); 2.3203 (5.6); 2.3140 (6.1); 2.2958 (3.1); 2.0916 (1.4); 2.0852 (1.2); 2.0674 (4.9); 2.0609 (3.8); 2.0476 (5.3); 2.0424 (6.5); 2.0369 (5.2); 2.0231 (4.0); 2.0170 (4.8); 1.9986 (1.6); 1.9914 (1.5); 1.8122 (1.3); 1.7870 (3.5); 1.7614 (3.4); 1.7362 (1.3); 1.7150 (0.4); 1.6777 (5.2); 1.6652 (14.8); 1.6573 (16.0); 1.6456 (6.4); 1.6131 (4.1); 1.5861 (3.6); 1.5652 (2.1); 1.5599 (2.1); 1.5408 (71.7); 1.3777 (0.5); 1.3383 (6.3); 1.3267 (15.1); 1.3188 (15.1); 1.3062 (5.3); 1.2552 (1.0); 0.8823 (0.3); 0.1472 (0.4); 0.0344 (0.4); -0.0002 (78.1); -0.1493 (0.4)</p>
<p>I.36: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.8043 (10.9); 8.3154 (0.5); 4.9153 (1.2); 4.8967 (4.7); 4.8782 (7.1); 4.8597 (4.8); 4.8411 (1.3); 3.3397 (106.7); 2.8931 (1.3); 2.7335 (1.2); 2.6739 (0.4); 2.5050 (61.4); 2.3315 (0.4); 2.2724 (1.8); 2.2669 (2.7); 2.2473 (6.1); 2.2437 (6.2); 2.2367 (5.5); 2.2238 (7.0); 2.2054 (3.3); 2.1997 (2.7); 1.9762 (1.4); 1.9702 (1.2); 1.9516 (5.4); 1.9455 (4.1); 1.9264 (7.3); 1.9074 (4.4); 1.9017 (5.6); 1.8840 (1.5); 1.8769 (1.7); 1.7492 (1.6); 1.7231 (4.1); 1.6978 (4.0); 1.6728 (1.4); 1.6235 (1.0); 1.5983 (2.7); 1.5776 (4.6); 1.5522 (4.1); 1.5316 (1.8); 1.5059 (0.5); 1.4454 (5.1); 1.4328 (14.0); 1.4249 (16.0); 1.4140 (6.7); 1.3742 (0.6); 1.2328 (1.1); 1.1913 (6.3); 1.1801 (14.8); 1.1722 (15.0); 1.1599 (5.4); -0.0002 (2.7)</p>
<p>I.37: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.8292 (3.9); 3.9916 (5.0); 3.9756 (10.1); 3.9596 (5.0); 3.3366 (28.9); 2.8936 (0.5); 2.7340 (0.5); 2.5096 (17.4); 2.5052 (22.1); 2.5008 (16.6); 1.5774 (0.6); 1.5593 (2.4); 1.5425 (4.7); 1.5246 (4.9); 1.5076 (2.5); 1.4899 (0.7); 1.4474 (2.3); 1.4350 (5.9); 1.4268 (6.4); 1.4158 (2.7); 1.2389 (0.4); 1.2037 (2.8); 1.1926 (6.2); 1.1844 (5.9); 1.1720 (2.1); 0.8624 (8.2); 0.8440 (16.0); 0.8254 (7.4); -0.0002 (0.5)</p>
<p>I.38: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.5059 (6.4); 7.2606 (24.7); 5.0390 (1.0); 5.0196 (3.5); 5.0013 (5.5); 4.9827 (4.1); 4.9646 (1.5); 2.9565 (0.5); 2.8836 (0.4); 2.3551 (2.3); 2.3355 (5.5); 2.3306 (5.9); 2.3241 (5.8); 2.3172 (6.4); 2.3109 (6.8); 2.2932 (4.1); 2.2874 (3.2); 2.0831 (1.2); 2.0756 (1.2); 2.0572 (4.7); 2.0506 (4.0); 2.0373 (5.6); 2.0317 (6.7); 2.0264 (5.9); 2.0130 (4.9); 2.0067 (5.4); 1.9886 (2.2); 1.9815 (2.0); 1.8102 (1.3); 1.7841 (3.4); 1.7582 (3.6); 1.7334 (1.6); 1.6758 (4.6); 1.6631 (13.7); 1.6554 (16.0); 1.6438 (8.6); 1.6112 (4.5); 1.5850 (3.9); 1.5477 (25.8); 1.3753 (0.6); 1.3667 (0.4); 1.3347 (5.6); 1.3231 (14.1); 1.3154 (15.3); 1.3030 (7.3); 1.2545 (2.5); 0.0698 (0.7); -0.0002 (30.6)</p>
<p>I.39: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.5215 (3.5); 7.2607 (14.3); 7.2447 (1.6); 4.0901 (5.2); 4.0736 (10.9); 4.0572 (6.4); 2.9559 (0.4); 2.8839 (0.4); 1.6877 (2.8); 1.6751 (8.0); 1.6673 (8.9); 1.6553 (6.9); 1.6367 (6.4); 1.6188 (6.5); 1.6014 (3.8); 1.5839 (1.5); 1.5481 (11.9); 1.3394 (3.2); 1.3277 (8.0); 1.3199 (8.5); 1.3075 (4.0); 1.2547 (1.0); 0.9240 (8.1); 0.9055 (16.0); 0.8870 (8.8); 0.0695 (1.5); -0.0002 (17.6); -0.0158 (2.3)</p>
<p>I.40: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.3772 (3.6); 7.2610 (11.3); 7.2444 (1.2); 4.0885 (5.3); 4.0721 (10.8); 4.0556 (6.3); 2.9558 (0.6); 2.8834 (0.5); 1.6880 (2.9); 1.6754 (8.0); 1.6677 (9.1); 1.6545 (5.8); 1.6344 (6.3); 1.6168 (6.7); 1.5991 (3.9); 1.5815 (1.5); 1.5514 (7.0); 1.3767 (0.3); 1.3364 (3.4); 1.3247 (8.1); 1.3170 (8.5); 1.3045 (3.8); 1.2549 (1.3); 0.9216 (8.1); 0.9032 (16.0); 0.8847 (8.7); 0.0694 (1.0); -0.0002 (13.6); -0.0166 (1.7)</p>

[0551]

<p>I.41: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.4157 (3.3); 7.2920 (0.4); 7.2600 (34.1); 4.0942 (5.3); 4.0778 (10.8); 4.0613 (5.6); 1.6905 (2.7); 1.6779 (8.2); 1.6700 (8.3); 1.6592 (5.6); 1.6431 (5.6); 1.6250 (5.8); 1.6075 (3.0); 1.5899 (1.0); 1.5396 (36.1); 1.3445 (3.2); 1.3328 (7.8); 1.3249 (7.9); 1.3125 (2.9); 1.2573 (0.4); 0.9299 (8.3); 0.9114 (16.0); 0.8928 (7.7); -0.0002 (40.3); -0.0415 (0.3)</p>
<p>I.42: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.3665 (6.4); 7.3015 (0.3); 7.2603 (37.2); 5.0356 (1.0); 5.0175 (3.9); 4.9990 (5.8); 4.9801 (4.0); 4.9612 (1.2); 2.3607 (1.8); 2.3539 (2.5); 2.3358 (5.4); 2.3296 (5.4); 2.3231 (5.0); 2.3162 (5.6); 2.3106 (5.9); 2.2919 (3.2); 2.2855 (2.4); 2.0793 (1.4); 2.0723 (1.2); 2.0541 (4.9); 2.0475 (3.7); 2.0343 (5.5); 2.0291 (6.3); 2.0233 (4.9); 2.0099 (4.3); 2.0035 (4.8); 1.9855 (1.5); 1.9790 (1.6); 1.8102 (1.3); 1.7833 (3.4); 1.7578 (3.4); 1.7328 (1.3); 1.7163 (0.5); 1.6770 (5.3); 1.6645 (14.8); 1.6566 (16.0); 1.6449 (6.6); 1.6361 (3.0); 1.6311 (2.8); 1.6106 (4.3); 1.5843 (3.5); 1.5635 (2.1); 1.5578 (2.3); 1.5438 (35.8); 1.3713 (0.6); 1.3314 (6.3); 1.3198 (15.2); 1.3119 (14.9); 1.2994 (5.5); 1.2597 (0.8); -0.0002 (46.1)</p>
<p>I.43: ¹H-NMR(500.1 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0051 (4.3); 4.0905 (2.1); 4.0764 (6.6); 4.0622 (6.7); 4.0480 (2.2); 3.3080 (14.8); 2.5040 (9.1); 2.5007 (12.5); 2.4974 (9.4); 1.4509 (1.9); 1.4412 (5.3); 1.4347 (5.7); 1.4258 (2.2); 1.1791 (2.8); 1.1751 (7.8); 1.1705 (6.3); 1.1611 (16.0); 1.1544 (2.5); 1.1468 (7.0); -0.0002 (7.6); -0.0064 (0.3)</p>
<p>I.44: ¹H-NMR(600.1 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.8524 (2.3); 4.0815 (2.1); 4.0766 (0.5); 4.0697 (6.8); 4.0649 (0.5); 4.0579 (6.8); 4.0461 (2.1); 3.3284 (53.8); 2.5101 (5.0); 2.5071 (11.1); 2.5040 (15.7); 2.5010 (11.2); 2.4979 (5.0); 1.4515 (2.0); 1.4433 (4.7); 1.4378 (5.1); 1.4303 (2.0); 1.1993 (2.0); 1.1917 (4.8); 1.1862 (4.8); 1.1781 (1.7); 1.1650 (0.4); 1.1541 (7.9); 1.1423 (16.0); 1.1305 (7.4); -0.0001 (0.7)</p>
<p>I.45: ¹H-NMR(600.1 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.8543 (1.3); 3.6179 (0.9); 3.6093 (16.0); 3.3227 (14.6); 2.8930 (0.9); 2.7338 (0.7); 2.5095 (2.9); 2.5065 (6.4); 2.5034 (9.0); 2.5004 (6.4); 2.4974 (2.8); 1.4613 (1.2); 1.4533 (2.8); 1.4477 (3.0); 1.4402 (1.2); 1.2153 (1.2); 1.2077 (2.8); 1.2022 (2.8); 1.1940 (1.0); -0.0001 (0.5)</p>
<p>I.46: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.5141 (4.4); 7.2604 (37.0); 7.2304 (0.5); 5.2992 (3.3); 3.9606 (15.6); 3.9426 (16.0); 1.7060 (3.9); 1.6935 (11.1); 1.6855 (11.6); 1.6739 (4.9); 1.6338 (0.6); 1.5462 (57.4); 1.5165 (0.9); 1.4977 (0.4); 1.3960 (0.4); 1.3563 (4.7); 1.3447 (11.5); 1.3366 (11.6); 1.3241 (4.2); 1.2862 (0.5); 1.2564 (0.3); 1.1274 (0.6); 1.1204 (0.9); 1.1087 (1.8); 1.1013 (1.6); 1.0894 (2.7); 1.0774 (1.7); 1.0706 (1.9); 1.0584 (1.1); 1.0515 (0.8); 1.0391 (0.4); 0.5580 (2.0); 0.5455 (6.9); 0.5430 (7.0); 0.5256 (7.3); 0.5111 (2.6); 0.4948 (0.6); 0.4744 (0.4); 0.2727 (2.4); 0.2607 (8.9); 0.2463 (8.5); 0.2343 (2.3); -0.0002 (46.0); -0.0295 (0.7)</p>
<p>I.47: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.5458 (3.7); 7.2614 (16.3); 5.2996 (3.9); 4.7166 (16.0); 4.7105 (15.2); 2.4664 (4.2); 2.4603 (7.4); 2.4543 (3.7); 1.7574 (3.3); 1.7446 (9.4); 1.7367 (9.3); 1.7246 (3.7); 1.6843 (0.3); 1.5599 (20.4); 1.3786 (3.9); 1.3668 (9.5); 1.3588 (9.2); 1.3459 (3.2); 1.3072 (0.4); 1.2589 (0.4); -0.0002 (18.1)</p>
<p>I.48: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.5431 (6.3); 7.2616 (21.2); 5.9182 (1.2); 5.9043 (2.5); 5.8915 (2.3); 5.8779 (3.3); 5.8615 (3.3); 5.8486 (2.6); 5.8351 (3.1); 5.8213 (1.6); 5.3101 (6.4); 5.3067 (6.1); 5.2996 (4.1); 5.2671 (5.5); 5.2638 (5.0); 5.2298 (6.8); 5.2270 (6.0); 5.2037 (6.2); 5.2009 (5.6); 4.6224 (14.6); 4.6085 (13.9); 1.7201 (5.4); 1.7075 (15.7); 1.6997 (15.4); 1.6879 (6.1); 1.6480 (0.7); 1.5659 (17.2); 1.3958 (0.5); 1.3556 (6.6); 1.3439 (16.0); 1.3360 (15.2); 1.3233 (5.6); 1.3053 (0.6); 1.2980 (0.6); 1.2844 (0.6); 1.2559 (1.1); 1.2249 (0.4); 1.2093 (0.3); -0.0002 (23.4)</p>
<p>I.49: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.5197 (0.4); 7.4793 (5.6); 7.2611 (25.1); 5.2993 (9.1); 1.6441 (0.6); 1.6362 (0.5); 1.6050 (5.0); 1.5926 (15.0); 1.5847 (15.8); 1.5733 (7.0); 1.5559 (21.6); 1.5334 (1.4); 1.4885 (0.4); 1.4730 (0.6); 1.4636 (1.0); 1.4337 (187.2); 1.3890 (1.6); 1.3308 (1.0); 1.3237 (0.7); 1.3177 (0.8); 1.3097 (0.8); 1.2910 (6.3); 1.2796 (15.3); 1.2717 (16.0); 1.2593 (6.0); 1.2365 (0.7); 1.2246 (1.9); 1.2089 (1.7); 1.2010 (0.6); 1.1856 (0.4); 0.9024 (0.6); 0.8853 (0.7); -0.0002 (32.3)</p>

[0552]

<p>I.50: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.5269 (2.9); 7.3898 (0.6); 7.3849 (0.9); 7.3642 (3.1); 7.3504 (6.5); 7.3391 (5.6); 7.3299 (10.1); 7.3244 (11.4); 7.3172 (6.7); 7.3082 (11.4); 7.2932 (3.3); 7.2591 (11.8); 5.2968 (1.2); 5.1523 (16.0); 5.1176 (12.2); 1.8406 (1.4); 1.7640 (0.5); 1.7476 (0.4); 1.7242 (2.3); 1.7115 (6.5); 1.7036 (6.7); 1.6918 (3.0); 1.6526 (0.4); 1.3617 (2.6); 1.3500 (6.5); 1.3418 (7.0); 1.3284 (7.5); 1.3201 (6.5); 1.3105 (2.8); 1.2704 (0.5); 1.2567 (0.6); 1.0327 (2.2); 1.0230 (5.8); 1.0150 (5.4); 1.0046 (2.1); -0.0002 (16.1)</p>
<p>I.51: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.4404 (1.3); 7.2605 (9.7); 4.7212 (5.9); 4.7152 (5.5); 2.4674 (1.6); 2.4613 (2.7); 2.4552 (1.3); 1.7580 (1.2); 1.7452 (3.5); 1.7373 (3.3); 1.7253 (1.3); 1.5559 (2.8); 1.3867 (1.5); 1.3747 (3.5); 1.3668 (3.3); 1.3540 (1.2); 1.3038 (3.3); 1.2653 (14.4); 0.8985 (6.6); 0.8820 (16.0); 0.8644 (7.0); -0.0002 (12.0)</p>
<p>I.52: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.5190 (0.4); 7.4370 (6.1); 7.2605 (61.6); 5.9240 (1.2); 5.9102 (2.6); 5.8970 (2.4); 5.8839 (3.4); 5.8673 (3.6); 5.8538 (2.7); 5.8410 (3.3); 5.8270 (1.8); 5.3163 (6.2); 5.3129 (6.3); 5.2733 (5.4); 5.2699 (5.4); 5.2323 (6.8); 5.2294 (6.6); 5.2062 (6.2); 5.2032 (6.0); 4.6266 (15.0); 4.6127 (14.6); 1.7219 (5.4); 1.7093 (15.6); 1.7013 (16.0); 1.6896 (6.4); 1.6490 (0.5); 1.5865 (0.3); 1.5486 (109.8); 1.5036 (0.4); 1.4029 (0.6); 1.3625 (6.5); 1.3507 (15.9); 1.3427 (16.0); 1.3301 (5.5); 1.2918 (0.4); 1.2592 (0.6); 0.8820 (0.4); -0.0002 (76.2); -0.1497 (0.4)</p>
<p>I.53: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.3512 (5.7); 7.2616 (25.2); 1.6479 (0.6); 1.6401 (0.4); 1.6096 (5.0); 1.5972 (15.5); 1.5893 (16.0); 1.5779 (7.0); 1.5624 (35.2); 1.5385 (1.2); 1.4846 (0.4); 1.4776 (0.5); 1.4647 (0.3); 1.4392 (191.8); 1.3969 (0.6); 1.3905 (0.4); 1.3261 (0.9); 1.3196 (0.7); 1.3115 (0.6); 1.2860 (6.4); 1.2746 (16.0); 1.2666 (15.9); 1.2543 (5.9); 1.2311 (1.8); 1.2154 (1.9); 1.2071 (0.5); 1.1913 (0.4); 0.9083 (0.6); 0.8914 (0.7); 0.8820 (0.4); 0.8758 (0.4); -0.0002 (31.0)</p>
<p>I.54: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.4142 (2.9); 7.3860 (0.5); 7.3608 (1.7); 7.3510 (3.5); 7.3399 (4.7); 7.3279 (11.2); 7.3155 (11.4); 7.2987 (3.0); 7.2599 (29.4); 5.1558 (16.0); 5.1200 (4.3); 1.7271 (2.4); 1.7145 (6.5); 1.7065 (6.8); 1.6948 (3.0); 1.6536 (1.3); 1.5975 (4.0); 1.4113 (0.4); 1.3708 (2.6); 1.3591 (6.5); 1.3511 (6.6); 1.3382 (2.8); 1.3346 (2.6); 1.3264 (2.3); 1.3163 (1.2); 1.3012 (0.5); 1.2756 (0.3); 1.2548 (0.6); 1.0540 (0.8); 1.0440 (1.9); 1.0361 (1.8); 1.0256 (0.7); -0.0002 (36.3)</p>
<p>I.55: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.4866 (5.0); 7.2611 (25.0); 5.2994 (16.0); 5.2067 (2.2); 5.1926 (4.0); 5.1865 (3.1); 5.1778 (2.4); 5.1718 (1.3); 1.8540 (1.0); 1.8392 (1.7); 1.8210 (3.2); 1.8063 (4.7); 1.7921 (3.4); 1.7669 (1.2); 1.6868 (4.6); 1.6581 (9.4); 1.6432 (8.6); 1.6306 (14.8); 1.6228 (15.0); 1.6111 (7.3); 1.5806 (4.1); 1.5713 (5.2); 1.5570 (55.3); 1.5170 (0.8); 1.3597 (0.4); 1.3194 (4.9); 1.3078 (12.0); 1.2999 (11.7); 1.2874 (4.2); 1.2596 (0.5); 1.2491 (0.4); -0.0002 (29.4)</p>
<p>I.56: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.5276 (1.4); 7.2608 (10.1); 5.2994 (2.9); 3.9051 (5.4); 3.8888 (5.5); 1.9400 (0.5); 1.9234 (0.9); 1.9067 (1.2); 1.8900 (1.0); 1.8732 (0.5); 1.6919 (1.2); 1.6794 (3.4); 1.6714 (3.6); 1.6598 (1.4); 1.5527 (19.6); 1.3432 (1.5); 1.3315 (3.5); 1.3235 (3.6); 1.3110 (1.2); 0.9024 (16.0); 0.8856 (15.5); -0.0002 (12.1)</p>
<p>I.57: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.5176 (3.0); 7.2606 (31.9); 5.2993 (5.6); 4.1303 (5.2); 4.1137 (10.4); 4.0972 (5.2); 1.6820 (2.6); 1.6694 (7.3); 1.6615 (7.4); 1.6498 (3.0); 1.6213 (1.1); 1.6045 (3.5); 1.5871 (4.7); 1.5672 (4.2); 1.5495 (72.0); 1.3851 (0.7); 1.3666 (2.6); 1.3478 (4.3); 1.3372 (4.1); 1.3263 (9.9); 1.3178 (7.9); 1.3105 (3.3); 1.3056 (3.0); 1.2921 (0.7); 0.9210 (8.4); 0.9026 (16.0); 0.8842 (7.0); -0.0002 (36.9)</p>
<p>I.58: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.4988 (1.3); 7.2608 (10.7); 5.2993 (2.3); 5.0501 (0.4); 5.0345 (1.1); 5.0189 (1.5); 5.0032 (1.1); 4.9876 (0.5); 1.6573 (1.2); 1.6447 (3.5); 1.6368 (3.6); 1.6252 (1.5); 1.5528 (22.6); 1.3289 (1.5); 1.3174 (3.6); 1.3094 (3.6); 1.2969 (1.3); 1.2246 (16.0); 1.2090 (16.0); -0.0002 (12.4)</p>

[0553]

<p>I.59: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.3705 (5.2); 7.2610 (33.0); 5.2126 (2.4); 5.1983 (4.3); 5.1921 (3.3); 5.1836 (2.4); 5.1775 (1.3); 1.8594 (1.0); 1.8442 (1.9); 1.8246 (3.5); 1.8086 (4.9); 1.7945 (3.6); 1.7696 (1.3); 1.6960 (5.0); 1.6880 (3.7); 1.6682 (10.6); 1.6479 (7.7); 1.6353 (16.0); 1.6275 (14.8); 1.6156 (7.5); 1.6029 (2.2); 1.5831 (4.2); 1.5749 (5.5); 1.5547 (66.8); 1.3600 (0.5); 1.3195 (5.5); 1.3080 (13.1); 1.3001 (12.4); 1.2875 (4.4); 1.2650 (0.6); 1.2507 (0.4); 1.2248 (0.4); 1.2091 (0.3); 0.8821 (0.4); -0.0002 (39.5)</p>
<p>I.60: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.4310 (1.5); 7.2612 (6.7); 3.9090 (5.4); 3.8926 (5.4); 1.9470 (0.5); 1.9302 (1.0); 1.9136 (1.2); 1.8969 (1.0); 1.8803 (0.5); 1.6945 (1.3); 1.6819 (3.6); 1.6740 (3.6); 1.6624 (1.5); 1.5576 (10.4); 1.3479 (1.5); 1.3362 (3.7); 1.3283 (3.6); 1.3158 (1.2); 0.9083 (16.0); 0.8915 (15.5); -0.0002 (8.2)</p>
<p>I.61: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.4127 (0.4); 7.2608 (2.0); 4.1342 (0.7); 4.1177 (1.4); 4.1011 (0.8); 4.0951 (0.4); 4.0785 (0.5); 2.0435 (0.4); 1.6840 (0.6); 1.6715 (1.2); 1.6635 (1.3); 1.6519 (0.7); 1.6274 (0.3); 1.6173 (0.4); 1.6108 (0.6); 1.5937 (0.8); 1.5734 (0.6); 1.3739 (0.5); 1.3550 (0.8); 1.3412 (1.0); 1.3302 (1.7); 1.3223 (2.4); 1.3044 (2.9); 1.2866 (4.0); 1.2653 (13.7); 0.9968 (0.4); 0.9888 (0.4); 0.9520 (0.4); 0.9335 (0.9); 0.9237 (1.3); 0.9148 (0.7); 0.9050 (3.4); 0.8987 (6.3); 0.8821 (16.0); 0.8644 (7.4); 0.8377 (0.4); -0.0002 (2.4)</p>
<p>I.62: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.3719 (1.4); 7.2604 (19.0); 5.0552 (0.4); 5.0396 (1.1); 5.0240 (1.5); 5.0084 (1.1); 4.9929 (0.4); 1.6606 (1.2); 1.6482 (3.5); 1.6403 (3.6); 1.6286 (1.5); 1.5472 (38.5); 1.3307 (1.5); 1.3193 (3.7); 1.3113 (3.5); 1.2988 (1.2); 1.2311 (16.0); 1.2154 (15.8); -0.0002 (23.4)</p>
<p>I.63: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.5419 (2.2); 7.5183 (0.4); 7.2599 (55.6); 7.2328 (0.4); 4.9283 (0.4); 4.7594 (16.0); 1.8045 (1.7); 1.7915 (5.2); 1.7834 (5.3); 1.7712 (2.2); 1.5810 (0.4); 1.5414 (77.9); 1.4929 (0.4); 1.4808 (0.4); 1.4386 (2.2); 1.4263 (5.7); 1.4184 (5.6); 1.4051 (2.1); 1.3657 (0.4); 1.3359 (1.4); 1.2840 (1.8); 1.2560 (10.3); 1.1844 (0.6); 1.1259 (0.4); 1.1051 (0.6); 1.0788 (0.4); 0.8812 (1.5); 0.8629 (1.0); 0.8452 (1.1); -0.0002 (68.6); -0.1496 (0.4)</p>
<p>I.64: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.5341 (6.3); 7.2635 (6.2); 4.5225 (5.2); 4.5017 (15.8); 4.4809 (16.0); 4.4601 (5.4); 1.7878 (5.2); 1.7747 (15.0); 1.7668 (15.1); 1.7546 (6.2); 1.7144 (0.6); 1.5842 (8.3); 1.4709 (0.5); 1.4306 (6.3); 1.4184 (15.2); 1.4105 (15.0); 1.3973 (5.2); 1.3588 (0.3); 1.2636 (0.4); 0.8819 (0.4); -0.0002 (7.1)</p>
<p>I.65: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.4672 (2.3); 7.2222 (9.8); 3.7612 (16.0); 1.9663 (2.7); 1.6302 (1.9); 1.6178 (5.5); 1.6098 (5.6); 1.5982 (2.3); 1.5156 (14.1); 1.2890 (2.4); 1.2775 (5.7); 1.2695 (5.6); 1.2569 (2.1); 1.2179 (1.5); 0.8433 (0.4); 0.1477 (0.4); -0.0002 (75.6); -0.0388 (11.9); -0.1510 (0.4)</p>
<p>I.66: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.6344 (7.0); 7.5181 (0.6); 7.3779 (6.7); 7.3590 (14.4); 7.3385 (10.4); 7.2594 (77.3); 7.2354 (5.7); 7.2169 (8.1); 7.1982 (3.3); 7.0944 (13.3); 7.0918 (15.0); 7.0729 (13.1); 6.9956 (0.5); 5.2980 (0.9); 2.0040 (15.1); 1.9248 (0.3); 1.8870 (5.4); 1.8743 (15.6); 1.8663 (16.0); 1.8543 (6.6); 1.8142 (0.5); 1.5420 (148.4); 1.5147 (1.1); 1.4890 (6.6); 1.4771 (15.9); 1.4690 (16.0); 1.4562 (5.8); 1.4177 (0.4); 1.2570 (0.9); 0.8824 (0.5); 0.1457 (0.4); 0.0191 (0.4); -0.0002 (90.0); -0.1487 (0.5)</p>
<p>I.67: ¹H-NMR(600.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0466 (6.7); 3.8998 (12.7); 3.8880 (12.8); 3.3236 (16.0); 2.5136 (2.8); 2.5106 (6.0); 2.5076 (8.2); 2.5046 (5.9); 2.5017 (2.7); 1.4619 (3.1); 1.4539 (7.9); 1.4484 (8.7); 1.4410 (3.4); 1.1920 (3.8); 1.1845 (8.7); 1.1790 (9.0); 1.1710 (3.2); 1.0838 (0.5); 1.0798 (0.6); 1.0786 (0.6); 1.0759 (0.4); 1.0718 (1.2); 1.0706 (1.2); 1.0666 (1.2); 1.0642 (1.0); 1.0624 (0.9); 1.0586 (2.2); 1.0546 (0.9); 1.0530 (1.0); 1.0506 (1.3); 1.0466 (1.3); 1.0455 (1.3); 1.0414 (0.4); 1.0384 (0.7); 1.0375 (0.7); 1.0335 (0.5); 0.5044 (1.8); 0.4971 (5.7); 0.4942 (5.8); 0.4911 (2.6); 0.4872 (2.6); 0.4837 (5.8); 0.4808 (5.5); 0.4738 (2.0); 0.2679 (2.0); 0.2607 (6.5); 0.2582 (6.1); 0.2529 (5.8); 0.2503 (6.7); 0.2430 (1.7)</p>

[0554]

<p>I.68: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.5171 (5.9); 7.2626 (11.3); 5.0297 (1.0); 5.0198 (1.9); 5.0101 (2.9); 5.0003 (3.7); 4.9906 (3.0); 4.9808 (2.1); 4.9711 (1.1); 3.8385 (3.0); 3.8288 (3.8); 3.8227 (3.6); 3.8110 (5.4); 3.7995 (4.7); 3.7935 (4.8); 3.7839 (4.0); 3.5753 (4.0); 3.5669 (4.4); 3.5556 (4.7); 3.5468 (7.2); 3.5377 (4.0); 3.5265 (3.9); 3.5180 (3.6); 1.9362 (1.6); 1.9272 (3.1); 1.9199 (3.2); 1.9124 (3.2); 1.9037 (3.6); 1.8950 (4.2); 1.8871 (4.2); 1.8801 (4.2); 1.8710 (2.3); 1.6938 (5.8); 1.6816 (14.0); 1.6734 (16.0); 1.6620 (9.8); 1.6524 (4.3); 1.6402 (4.5); 1.6298 (3.8); 1.6202 (2.6); 1.6102 (2.1); 1.5783 (16.2); 1.3898 (0.4); 1.3495 (5.0); 1.3379 (12.2); 1.3299 (12.0); 1.3173 (4.5); 1.2787 (0.5); 1.2571 (0.4); -0.0002 (14.0)</p>
<p>I.69: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.4894 (2.4); 7.2252 (2.7); 3.7603 (16.0); 1.6272 (2.0); 1.6147 (5.4); 1.6068 (5.6); 1.5951 (2.4); 1.5539 (4.3); 1.2858 (2.4); 1.2742 (5.6); 1.2662 (5.6); 1.2536 (2.1); 0.1476 (0.4); 0.0444 (0.4); 0.0422 (0.4); 0.0330 (0.3); -0.0002 (75.6); -0.0392 (3.8); -0.0475 (0.5); -0.0560 (0.4); -0.1511 (0.4)</p>
<p>I.70: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.5028 (6.5); 7.2637 (10.8); 5.3836 (0.4); 5.0304 (1.1); 5.0208 (2.2); 5.0110 (3.2); 5.0013 (4.1); 4.9915 (3.2); 4.9818 (2.1); 4.9722 (1.0); 4.1921 (0.3); 3.8382 (3.4); 3.8285 (4.3); 3.8225 (4.1); 3.8105 (5.9); 3.7991 (5.1); 3.7934 (5.2); 3.7837 (4.2); 3.5762 (4.7); 3.5679 (5.0); 3.5565 (5.4); 3.5477 (8.0); 3.5387 (4.3); 3.5273 (4.2); 3.5190 (3.8); 1.9370 (1.9); 1.9282 (3.5); 1.9210 (3.6); 1.9138 (3.6); 1.9039 (4.0); 1.8951 (4.6); 1.8882 (4.6); 1.8813 (4.5); 1.8722 (2.3); 1.6962 (5.7); 1.6837 (15.7); 1.6757 (16.0); 1.6638 (10.1); 1.6520 (4.2); 1.6399 (4.6); 1.6295 (3.8); 1.6198 (2.3); 1.6097 (2.1); 1.5921 (15.3); 1.3939 (0.5); 1.3537 (5.8); 1.3419 (13.8); 1.3340 (13.2); 1.3214 (4.7); 1.2985 (0.6); 1.2812 (1.0); 1.2632 (0.7); 1.1647 (0.5); -0.0002 (13.4)</p>
<p>I.71: ¹H-NMR(600.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0798 (6.5); 5.5610 (0.9); 5.5480 (3.4); 5.5350 (5.2); 5.5220 (3.5); 5.5089 (0.9); 3.3935 (4.2); 3.3906 (2.3); 3.3800 (7.2); 3.3770 (8.1); 3.3665 (3.2); 3.3636 (6.0); 3.3231 (16.0); 3.3002 (6.0); 3.2972 (3.3); 3.2874 (7.7); 3.2840 (6.4); 3.2740 (2.3); 3.2710 (4.2); 2.5137 (4.3); 2.5107 (9.2); 2.5077 (12.6); 2.5047 (9.1); 2.5017 (4.3); 1.4960 (3.2); 1.4878 (8.0); 1.4823 (8.7); 1.4748 (3.4); 1.2499 (0.4); 1.2409 (0.4); 1.2234 (3.6); 1.2158 (8.2); 1.2103 (8.4); 1.2021 (3.0)</p>
<p>I.72: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.5661 (2.1); 7.2608 (12.0); 4.7583 (16.0); 2.0061 (1.4); 1.8020 (1.7); 1.7889 (4.9); 1.7809 (4.9); 1.7686 (2.1); 1.5524 (17.0); 1.4356 (2.1); 1.4233 (5.1); 1.4153 (5.0); 1.4022 (1.8); 1.2843 (0.4); 1.2564 (2.0); 0.8821 (0.6); 0.8638 (0.3); -0.0002 (14.2)</p>
<p>I.73: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.6574 (8.2); 7.3749 (6.8); 7.3551 (14.8); 7.3356 (10.5); 7.2587 (10.0); 7.2321 (5.4); 7.2136 (8.0); 7.1950 (3.2); 7.0905 (15.8); 7.0713 (13.3); 1.9208 (0.4); 1.8818 (5.4); 1.8690 (15.4); 1.8612 (16.0); 1.8492 (6.3); 1.8090 (0.5); 1.5668 (4.8); 1.5235 (0.6); 1.4834 (6.4); 1.4714 (15.7); 1.4636 (15.9); 1.4508 (5.5); 1.4118 (0.3); 1.2550 (0.8); -0.0002 (12.9)</p>
<p>I.74: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.5486 (6.2); 7.2611 (16.9); 4.5211 (5.3); 4.5003 (15.9); 4.4795 (16.0); 4.4587 (5.4); 1.7866 (5.2); 1.7736 (14.9); 1.7657 (14.6); 1.7534 (6.0); 1.7134 (0.6); 1.5548 (8.9); 1.4673 (0.5); 1.4270 (6.4); 1.4148 (15.0); 1.4069 (14.6); 1.3937 (5.2); 1.3551 (0.3); 1.2649 (0.7); 0.8821 (0.6); -0.0002 (22.9)</p>
<p>I.75: ¹H-NMR(400.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.4958 (2.1); 7.2611 (11.6); 5.6817 (0.4); 5.6617 (1.4); 5.6421 (2.2); 5.6222 (1.5); 5.6026 (0.4); 3.4671 (1.6); 3.4429 (3.2); 3.4221 (2.1); 3.3034 (2.4); 3.2839 (3.4); 3.2796 (3.0); 3.2597 (1.8); 2.0064 (16.0); 1.6947 (1.6); 1.6819 (4.4); 1.6739 (4.6); 1.6621 (1.9); 1.5514 (6.0); 1.3506 (1.9); 1.3387 (4.6); 1.3308 (4.6); 1.3180 (1.7); 1.2549 (0.6); -0.0002 (15.2)</p>
<p>II.a.01: ¹H-NMR(300.2 MHz, CDCl₃): δ= 7.2997 (5.8); 5.3391 (1.0); 4.1328 (5.2); 4.1187 (0.5); 4.1110 (5.2); 2.9515 (0.4); 2.1210 (0.4); 2.0987 (0.8); 2.0764 (1.1); 2.0542 (0.9); 2.0319 (0.5); 1.5936 (5.3); 1.4701 (0.6); 1.0596 (0.5); 1.0425 (16.0); 1.0201 (15.3); 1.0031 (0.8); 0.9866 (0.5); 0.9806 (0.8); 0.9727 (1.8); 0.9645 (0.5); 0.9504 (1.7); 0.1085 (0.7); 0.0376 (5.6)</p>
<p>II.a.02: ¹H-NMR(499.9 MHz, CDCl₃): δ= 7.2672 (1.2); 4.4055 (2.5); 4.3912 (7.7); 4.3769 (7.8); 4.3627 (2.6); 2.0088 (0.9); 1.4065 (8.0); 1.3922 (16.0); 1.3780 (8.0); 1.2628 (0.4); 1.2538 (1.0); -0.0002 (1.4)</p>

[0555]

<p>II.a.03: 1H-NMR(300.2 MHz, CDCl₃): δ= 7.6041 (0.4); 7.2984 (2.1); 3.9506 (16.0); 3.9244 (1.2); 1.5852 (1.8); 0.0364 (2.4)</p>
<p>II.a.04: 1H-NMR(499.9 MHz, d₆-DMSO): δ= 15.1027 (0.3); 14.9975 (0.4); 14.9759 (0.4); 14.9509 (0.4); 14.9312 (0.4); 14.8896 (0.4); 14.8671 (0.5); 14.8450 (0.5); 14.7865 (0.6); 14.7539 (0.7); 14.6142 (1.0); 14.5943 (1.2); 14.5485 (1.4); 14.5271 (1.5); 14.5236 (1.5); 14.2968 (4.7); 14.1541 (7.0); 14.0699 (5.8); 13.9449 (3.2); 13.8394 (2.0); 13.5699 (0.8); 13.5440 (0.8); 13.4921 (0.6); 13.4731 (0.6); 13.4502 (0.6); 13.4216 (0.6); 13.3628 (0.5); 13.3451 (0.5); 13.3306 (0.4); 13.2703 (0.5); 13.2252 (0.4); 13.2010 (0.4); 13.1591 (0.4); 13.1269 (0.3); 13.0464 (0.3); 7.7544 (8.9); 7.4284 (1.4); 4.5359 (0.3); 4.4060 (0.3); 4.3940 (0.3); 4.3632 (0.4); 4.3500 (0.4); 4.3401 (0.4); 4.2742 (0.4); 4.2369 (0.4); 4.2278 (0.5); 4.2094 (0.5); 4.1782 (0.5); 4.1293 (0.5); 4.1189 (0.6); 4.1132 (0.6); 4.1025 (0.6); 4.0515 (0.6); 4.0446 (0.7); 4.0191 (0.7); 3.9836 (0.8); 3.9763 (0.8); 3.9301 (0.9); 3.8612 (1.0); 3.4109 (6.4); 3.3496 (7.0); 3.1621 (3.7); 2.8672 (1.0); 2.8488 (1.0); 2.8394 (0.9); 2.8120 (0.8); 2.8052 (0.8); 2.7588 (0.9); 2.7233 (0.7); 2.7027 (0.7); 2.6458 (1.7); 2.6421 (2.1); 2.6172 (0.7); 2.5952 (0.7); 2.5818 (0.7); 2.5143 (96.0); 2.5108 (196.0); 2.5072 (264.8); 2.5037 (189.8); 2.5002 (88.3); 2.3720 (1.1); 2.3683 (1.6); 2.3644 (1.2); 2.1856 (0.5); 2.0896 (16.0); 2.0780 (0.4); 1.9135 (0.5); 1.3579 (3.0); 1.3421 (1.0); 1.3177 (0.4); 1.3006 (1.0); 1.2736 (0.5); 1.2600 (1.1); 1.2307 (1.5); 1.2053 (0.4); 1.1833 (2.4); 1.1716 (1.1); 1.0969 (0.4); 0.8541 (0.5)</p>
<p>II.a.05: 1H-NMR(499.9 MHz, d₆-DMSO): δ= 3.8598 (16.0); 3.3560 (0.5); 2.5322 (0.6); 2.5288 (1.2); 2.5253 (1.7); 2.5217 (1.2); 2.5184 (0.6)</p>
<p>II.a.06: 1H-NMR(300.2 MHz, CDCl₃): δ= 7.2983 (1.3); 3.9521 (16.0); 1.5875 (0.4); 0.0350 (1.7)</p>
<p>II.a.07: 1H-NMR(300.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 19.6514 (1.2); 19.4242 (1.2); 14.4211 (1.5); 14.2144 (4.5); 14.0488 (9.5); 13.9419 (4.6); 13.7837 (1.7); 13.6736 (1.2); 13.6487 (1.2); 13.5662 (1.3); 9.3511 (1.3); 5.7749 (3.0); 4.0838 (1.6); 4.0599 (3.6); 4.0367 (3.6); 4.0129 (1.4); 3.7199 (1.5); 3.6986 (1.4); 3.6881 (1.6); 3.6447 (2.0); 3.5905 (2.2); 3.5604 (2.8); 3.3605 (11.6); 3.1076 (1.9); 3.0934 (1.9); 3.0852 (2.0); 3.0078 (1.6); 2.9717 (1.3); 2.9121 (1.4); 2.8858 (1.6); 2.7479 (1.7); 2.5339 (95.7); 2.5278 (198.8); 2.5217 (271.4); 2.5157 (195.8); 2.5096 (91.8); 2.4429 (1.8); 2.4204 (1.3); 2.2912 (2.1); 2.0080 (16.0); 1.2510 (7.5); 1.2177 (5.6); 1.1940 (10.0); 1.1702 (5.6); 0.8674 (1.7); 0.8481 (1.5); 0.8110 (1.2); 0.0286 (13.0); 0.0178 (337.9); 0.0069 (13.0); -0.0500 (1.4); -0.1807 (1.7)</p>
<p>II.a.08: 1H-NMR(499.9 MHz, CDCl₃): δ= 7.2630 (2.8); 4.4029 (2.5); 4.3887 (7.6); 4.3744 (7.7); 4.3601 (2.6); 2.0073 (0.6); 1.5552 (2.0); 1.4026 (8.0); 1.3883 (16.0); 1.3740 (7.8); 1.2543 (0.5); -0.0002 (3.2)</p>
<p>II.a.09: 1H-NMR(499.9 MHz, CDCl₃): δ= 7.2606 (15.4); 5.2995 (3.1); 4.3996 (2.5); 4.3853 (7.7); 4.3710 (7.8); 4.3568 (2.6); 1.5458 (28.2); 1.3998 (8.0); 1.3856 (16.0); 1.3713 (7.9); 1.2560 (0.6); -0.0002 (15.9)</p>
<p>IV.a.01: 1H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.7327 (3.0); 8.0481 (4.2); 8.0381 (4.2); 4.0875 (2.4); 4.0699 (7.4); 4.0521 (7.5); 4.0344 (2.5); 3.3389 (56.6); 2.5269 (0.4); 2.5132 (10.1); 2.5092 (19.6); 2.5048 (25.0); 2.5004 (18.0); 2.0758 (0.7); 1.4499 (2.0); 1.4377 (5.5); 1.4294 (5.9); 1.4184 (2.4); 1.2993 (0.5); 1.2594 (0.8); 1.2393 (2.1); 1.1964 (2.6); 1.1853 (5.8); 1.1770 (5.5); 1.1644 (2.4); 1.1592 (8.1); 1.1415 (16.0); 1.1237 (7.7); 0.8535 (0.5); -0.0002 (0.8)</p>
<p>IV.b.01: 1H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.7731 (2.4); 8.3151 (5.0); 7.4172 (7.9); 4.0894 (2.1); 4.0717 (6.7); 4.0540 (6.7); 4.0362 (2.1); 3.3267 (10.3); 3.3026 (1.5); 2.5254 (0.4); 2.5206 (0.6); 2.5119 (7.7); 2.5075 (15.6); 2.5029 (20.3); 2.4983 (14.5); 2.4937 (6.9); 1.4457 (1.8); 1.4334 (4.4); 1.4251 (4.8); 1.4141 (2.0); 1.1822 (2.0); 1.1689 (9.3); 1.1629 (4.4); 1.1510 (16.0); 1.1333 (7.0); -0.0002 (2.4)</p>
<p>IV.b.02: 1H-NMR(600.1 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.8939 (2.0); 8.3116 (3.7); 7.4235 (0.4); 7.4075 (5.4); 4.0887 (1.3); 4.0768 (4.0); 4.0722 (0.5); 4.0650 (4.0); 4.0604 (0.5); 4.0532 (1.3); 3.3325 (5.2); 3.3283 (15.0); 3.3245 (16.0); 3.3010 (1.0); 2.5086 (4.3); 2.5057 (9.0); 2.5027 (12.2); 2.4997 (8.6); 2.4969 (3.9); 1.4368 (1.2); 1.4289 (3.1); 1.4234 (3.3); 1.4160 (1.3); 1.1846 (4.4); 1.1727 (9.2); 1.1609 (4.6); 1.1528 (1.5); 1.1453 (3.2); 1.1398 (3.1); 1.1319 (1.1)</p>

[0556]

IVb.03: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2597 (13.8); 6.8664 (10.0); 6.7007 (2.6); 6.6837 (2.5); 4.1866 (2.9); 4.1703 (8.0); 4.1524 (7.9); 4.1350 (2.7); 2.9545 (0.4); 2.8817 (0.3); 1.6436 (10.4); 1.5880 (0.4); 1.5423 (10.2); 1.3280 (0.4); 1.2719 (10.7); 1.2483 (9.0); 1.2302 (16.0); 1.2127 (8.0); -0.0002 (17.6)
IVb.05: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.8497 (3.1); 7.4168 (8.3); 4.0937 (1.8); 4.0759 (5.5); 4.0582 (5.5); 4.0405 (1.8); 3.3552 (20.7); 3.3478 (40.9); 2.5097 (15.5); 2.5053 (19.3); 2.5009 (14.6); 1.4464 (1.6); 1.4343 (4.3); 1.4261 (4.7); 1.4152 (2.1); 1.2400 (1.0); 1.1799 (6.2); 1.1722 (3.0); 1.1621 (16.0); 1.1531 (5.7); 1.1444 (6.7); -0.0002 (0.5)
IVc.01: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.4521 (2.4); 7.4385 (2.6); 7.4336 (2.6); 7.4201 (2.4); 7.2982 (6.6); 6.8863 (4.0); 6.8853 (3.8); 6.8679 (4.1); 6.8326 (0.8); 4.2365 (2.4); 4.2127 (7.4); 4.1890 (7.6); 4.1653 (2.5); 1.7130 (2.0); 1.6964 (5.8); 1.6855 (5.9); 1.6704 (2.6); 1.6281 (6.3); 1.6174 (0.4); 1.3423 (2.7); 1.3272 (6.0); 1.3163 (6.1); 1.2996 (2.6); 1.2915 (8.3); 1.2677 (16.0); 1.2440 (7.7); 0.9161 (0.4); 0.0340 (6.6)
V.01: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.3382 (10.3); 7.3044 (7.9); 6.7676 (2.0); 4.2423 (2.4); 4.2185 (7.5); 4.1947 (7.6); 4.1710 (2.5); 2.8481 (4.7); 1.7064 (2.0); 1.6896 (5.6); 1.6789 (5.8); 1.6635 (2.5); 1.6420 (3.4); 1.3285 (2.7); 1.3132 (6.2); 1.2986 (9.4); 1.2856 (2.5); 1.2747 (16.0); 1.2509 (7.6); 0.0405 (8.1)
V.02: ¹ H-NMR(499.9 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2919 (4.7); 7.2623 (3.9); 6.7012 (1.2); 5.0384 (0.4); 5.0259 (1.1); 5.0134 (1.5); 5.0009 (1.2); 4.9885 (0.5); 1.6259 (1.1); 1.6160 (3.3); 1.6098 (3.4); 1.6003 (1.4); 1.5902 (7.5); 1.2665 (1.5); 1.2572 (3.9); 1.2510 (3.8); 1.2410 (1.3); 1.2203 (16.0); 1.2078 (16.0); -0.0002 (3.6)
V.03: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.3126 (10.3); 7.2989 (6.2); 6.7720 (1.8); 5.3370 (0.8); 4.2375 (2.4); 4.2137 (7.4); 4.1899 (7.5); 4.1662 (2.4); 1.7013 (1.9); 1.6845 (5.2); 1.6738 (5.4); 1.6584 (2.3); 1.6307 (5.4); 1.3234 (2.6); 1.3080 (5.9); 1.2938 (10.0); 1.2805 (2.6); 1.2700 (16.0); 1.2462 (7.6); 0.0350 (7.0)
V.04: ¹ H-NMR(300.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.3043 (2.1); 7.8355 (6.1); 3.6265 (16.0); 3.3513 (2.6); 2.5338 (0.5); 2.5280 (1.1); 2.5220 (1.4); 2.5160 (1.0); 2.5102 (0.5); 1.5032 (1.1); 1.4868 (2.8); 1.4758 (3.0); 1.4614 (1.3); 1.2090 (1.4); 1.1945 (3.0); 1.1835 (2.8); 1.1671 (1.0); 0.0164 (0.9)
V.05: ¹ H-NMR(300.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 12.6058 (0.4); 9.2124 (7.5); 7.8263 (16.0); 3.3584 (1.5); 2.5282 (4.5); 2.5223 (6.0); 2.5164 (4.5); 2.0945 (0.8); 1.4547 (2.9); 1.4388 (7.3); 1.4281 (8.1); 1.4141 (3.6); 1.3612 (0.3); 1.1423 (3.6); 1.1282 (7.8); 1.1174 (7.5); 1.1015 (2.8); 0.0173 (2.2)
XI.01: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2985 (0.9); 6.2968 (2.9); 5.8790 (3.7); 4.2235 (2.2); 4.1997 (6.7); 4.1760 (6.8); 4.1523 (2.2); 2.0305 (0.4); 1.6536 (1.9); 1.6373 (5.4); 1.6265 (5.6); 1.6115 (2.3); 1.2774 (7.2); 1.2538 (16.0); 1.2401 (6.2); 1.2298 (12.0); 1.2129 (2.1); 0.0202 (0.8)
XIIa.01: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.3430 (0.4); 7.2989 (4.6); 6.7348 (0.4); 4.2303 (0.5); 4.2066 (1.5); 4.1828 (1.6); 4.1591 (0.5); 1.6856 (0.4); 1.6690 (1.2); 1.6582 (1.2); 1.6430 (0.6); 1.6095 (2.7); 1.5410 (16.0); 1.2930 (2.2); 1.2790 (1.3); 1.2691 (4.4); 1.2514 (0.6); 1.2454 (1.6); 0.0368 (5.5)
XIII.01: ¹ H-NMR(499.9 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2626 (1.0); 5.7182 (0.9); 3.8289 (16.0); 1.5821 (0.5); -0.0002 (1.1)
XIII.02: ¹ H-NMR(300.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 13.4605 (1.6); 13.3786 (1.6); 13.2747 (2.0); 13.2607 (2.1); 13.2418 (2.4); 13.1976 (2.6); 13.1780 (2.4); 13.1651 (2.6); 13.0998 (2.9); 13.0936 (2.9); 13.0821 (3.0); 13.0381 (3.2); 12.9902 (3.5); 12.9696 (3.4); 12.9563 (3.4); 12.9261 (3.3); 12.9166 (3.1); 12.9040 (3.3); 12.8582 (3.1); 12.8359 (3.4); 12.8242 (3.0); 12.7876 (2.7); 12.6640 (2.0); 12.5368 (1.6); 12.5068 (1.6); 12.4811 (1.6); 7.1025 (1.6); 7.0457 (2.2); 7.0074 (2.0); 6.9258 (3.4); 6.8352 (5.3); 6.6472 (16.0); 6.5167 (6.9); 6.4124 (2.9); 6.3341 (1.8); 6.1823 (1.6); 3.9925 (1.7); 3.8936 (1.8); 3.7735 (1.8); 3.7667 (1.6); 3.6496 (2.9); 3.3680 (566.0); 3.2044 (4.4); 3.0765 (1.6); 3.0065 (1.9); 2.9799 (1.6); 2.7531 (2.5); 2.5392 (262.9); 2.5339 (326.0); 2.3041 (2.0); 1.2671 (1.7); 0.2259 (1.9); 0.0305 (246.1); -0.0116 (1.7); -1.0984 (1.8)
XIV.01: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 8.0902 (0.4); 7.2984 (6.7); 3.9068 (16.0); 2.2651 (12.6); 1.5989 (5.4); 0.1070 (0.6); 0.0362 (6.1)
XIV.02: ¹ H-NMR(300.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.9025 (1.1); 8.0098 (0.7); 3.3874 (0.6); 3.3540 (0.6); 3.3136 (0.5); 2.5463 (8.0); 2.5404 (17.3); 2.5344 (24.4); 2.5284 (17.8); 2.5226 (8.5); 2.0407 (16.0); 1.9413 (0.4); 1.2066 (0.4); 0.0431 (0.8); 0.0322 (28.2); 0.0211 (1.1)

[0557]

[0558] 生物数据-式(I)的化合物

[0559] 下文描述的实施例A显示了式(I)的化合物在拟南芥(*Arabidopsis thaliana*)中诱导防御基因的表达,特别是刺激了水杨酸路径。因此,这些化合物可以诱导宿主防御,从而保护植物抵抗宽范围的病原体(包括细菌和真菌)。

[0560] 下文描述的实施例B、C和D显示了式(I)的化合物对各种病原体(包括细菌和真菌)的直接无活性的体外细胞测试,从而说明了式(I)的化合物作为植物宿主防御诱导剂的作用模式。

[0561] 下文描述的实施例E、F、G、H和I显示了通过刺激植物防御以抵抗各种感染植物的病原体(包括细菌和真菌)的式(I)的化合物在植物中的体内活性。

[0562] 下文描述的实施例J、K、L、M和N显示了根据W02004/024692的教导制备的化合物与根据本发明的式(I)的化合物相比在植物中的体内活性的比较实施例。

[0563] 实施例A:诱导拟南芥(*Arabidopsis thaliana*)中防御基因的表达

[0564] 使含有与PR1(病原性相关蛋白I)基因(AT2G14610)的水杨酸盐反应性启动子序列连接的绿色荧光蛋白(green fluorescent protein;GFP)的编码序列的拟南芥报道植物生长五天,然后用化合物喷洒。在喷洒后第3天,使用购自Leica Microsystems(Wetzlar, Germany)的MacroFluo仪器测定植物荧光。用Meta-Morph Microscopy Automation&图像分析软件(Molecular Devices,Sunnyvale,Calif.,United States)对荧光进行量化。

[0565] 将经模拟处理叶片的背景荧光设定为1.00。水杨酸处理(300ppm)产生2.70的相对荧光值,从而证明测试系统的有效性。

[0566] 在该测试中,本发明的以下化合物在300ppm的化合物浓度下显示出至少大于2的相对荧光值:I.01;I.02;I.03;I.04;I.05;I.06;I.07;I.08;I.09;I.10;I.11;I.12;I.13;I.14;I.15;I.16;I.17;I.18;I.20;I.21;I.22;I.23;I.24;I.25;I.26;I.27;I.28;I.29;I.30;I.31;I.32;I.33;I.34;I.36;I.37;I.38;I.39;I.40;I.41;I.42;I.44;I.45。

[0567] 在该测试中,本发明的以下化合物在75ppm的化合物浓度下显示出至少大于2的相对荧光值:I.02;I.03;I.05;I.09;I.10;I.11;I.12;I.13;I.15;I.16;I.17;I.18;I.20;I.23;I.24;I.28;I.29;I.31;I.32;I.33;I.34;I.36;I.37;I.42;I.45。水杨酸盐为抵抗植物病原体的主要防御激素。上文所描述的所有化合物刺激了水杨酸路径,因此可保护植物抵抗宽范围的病原体。

[0568] 实施例B:番茄细菌性斑点病菌(*Pseudomonas syringae* pv. *tomato*)的体外细胞测试

[0569] 溶剂:DMSO

[0570] 培养基:LB肉汤培养基(Luria Broth Miller)Sigma

[0571] 接种物:细菌悬浮液

[0572] 将待测试的化合物溶解于DMSO,并且将溶液用于制备所需的浓度范围。在测试中使用的DMSO的最终浓度为 $\leq 1\%$ 。

[0573] 接种物由在液体培养基中生长的细菌的预培养物制备,并稀释至所需的光密度(OD)。

[0574] 在液体培养物测试中,评估化合物抑制细菌生长的能力。将化合物以所需浓度添加至含有细菌悬浮液的培养基中。在温育24h之后,通过光谱法测量细菌生长以测定化合物

的功效。通过将在含有化合物的孔中的吸光度与在不含化合物的对照孔中的吸光度进行比较来测定抑制性。

[0575] 在该测试中,本发明的以下化合物在20ppm的活性成分浓度下不显示出直接的活性(功效低于或等于30%):I.01;I.02;I.03;I.04;I.05;I.06;I.07;I.08;I.09;I.10;I.11;I.12;I.13;I.14;I.15;I.16;I.44;I.45。

[0576] 实施例C:灰葡萄孢的体外细胞测试

[0577] 溶剂:DMSO

[0578] 培养基:14.6g无水D-葡萄糖(VWR),7.1g真菌蛋白胨(Mycolological Peptone)(Oxoid),1.4g粒状酵母提取物(Merck),QSP 1升

[0579] 接种物:孢子悬浮液

[0580] 将杀真菌剂溶于DMSO中,将溶液用于制备所需的浓度范围。试验中使用的DMSO终浓度为 $\leq 1\%$ 。

[0581] 制备灰葡萄孢(*B. cinerea*)的孢子悬浮液,并稀释至所需的孢子密度。

[0582] 在液体培养测定中,评估杀真菌剂抑制孢子萌芽和菌丝体生长的能力。将化合物以所需浓度添加到含孢子的培养基中。温育5天后,通过光谱法测量菌丝体生长以测定化合物的真菌毒性。通过比较在含有杀真菌剂的孔中的吸光度值与在不含杀真菌剂的对照孔中的吸光度来确定对于真菌生长的抑制作用。

[0583] 在该测试中,本发明的以下化合物在20ppm的活性成分浓度下不显示出直接的活性(功效低于或等于30%):I.01;I.02;I.03;I.04;I.05;I.06;I.07;I.08;I.09;I.10;I.11;I.12;I.13;I.14;I.15;I.16;I.44;I.45。

[0584] 实施例D:野油菜黄单胞菌野油菜致病变种的体外细胞测试

[0585] 溶剂:DMSO

[0586] 培养基:LB肉汤培养基(Luria Broth Miller)Sigma

[0587] 接种物:细菌悬浮液

[0588] 将化合物溶解于DMSO,并且将溶液用于制备所需的浓度范围。在测试中使用的DMSO的最终浓度为 $\leq 1\%$ 。

[0589] 接种物由在液体培养基中生长的细菌的预培养物制备,并稀释至所需的光密度(OD)。

[0590] 在液体培养物测试中,评估化合物抑制细菌生长的能力。将化合物以所需浓度添加至含有细菌悬浮液的培养基中。在温育24h之后,通过光谱法测量细菌生长以测定化合物的功效。通过将在含有化合物的孔中的吸光度与在不含化合物的对照孔中的吸光度进行比较来测定抑制性。

[0591] 在该测试中,本发明的以下化合物在20ppm的活性成分浓度下不显示出直接的活性(功效低于或等于30%):I.01;I.02;I.03;I.04;I.05;I.06;I.07;I.08;I.09;I.10;I.11;I.12;I.13;I.14;I.15;I.16;I.44;I.45。

[0592] 实施例E:对番茄细菌性斑点病菌(番茄上的细菌性斑点病)的体内预防性测试

[0593] 通过在丙酮/二甲基亚砜/tween®的混合物中均质化来制备所测试的活性成分,然后用水稀释以获得所需的活性材料浓度。

[0594] 通过喷洒根据上文所述制备的活性成分来处理番茄的幼苗。对照植物仅用丙酮/

二甲基亚砜/**tween®**的水溶液进行处理。

[0595] 在72小时后,通过用番茄细菌性斑点病菌的水性细菌悬浮液喷洒叶片来污染植物。将污染的番茄植物在22°C日/20°C夜-70%HR的饱和大气下温育4天,然后在22°C日/20°C夜,70-80%的相对湿度下温育1或2天。

[0596] 在温育后的第5或6天评估测试。0%表示对应于对照植物的功效,而100%的功效表示没有观察到病害。

[0597] 在该测试中,本发明的以下化合物在500ppm的活性成分浓度下显示出80%至89%的功效:I.01。

[0598] 在该测试中,本发明的以下化合物在500ppm的活性成分浓度下显示出90%至100%的功效:I.02;I.09。

[0599] 在该测试中,本发明的以下化合物在31ppm的活性成分浓度下显示出70%至79%的功效:I.07;I.09;I.11;I.12;I.15;I.26。

[0600] 在该测试中,本发明的以下化合物在31ppm的活性成分浓度下显示出80%至89%的功效:I.03;I.16;I.21;I.22;I.25;I.33;I.37;I.45。

[0601] 在该测试中,本发明的以下化合物在31ppm的活性成分浓度下显示出90%至100%的功效:I.10;I.17;I.23;I.24;I.40。

[0602] 在该测试中,本发明的以下化合物在125ppm的活性成分浓度下显示出70%至79%的功效:I.03;I.09;I.25;I.33;I.39;I.43。

[0603] 在该测试中,本发明的以下化合物在125ppm的活性成分浓度下显示出80%至89%的功效:I.01;I.12;I.14;I.20;I.34;I.36;I.45。

[0604] 在该测试中,本发明的以下化合物在125ppm的活性成分浓度下显示出90%至100%的功效:I.10;I.11;I.15;I.16;I.17;I.18;I.21;I.22。

[0605] 实施例F:对寄生霜霉(Peronosporaparasitica) (十字花科蔬菜霜霉病)的体内预防性测试

[0606] 通过在丙酮/二甲基亚砜/**tween®**的混合物中均质化来制备所测试的活性成分,然后用水稀释以获得所需的活性材料浓度。

[0607] 通过喷洒根据上文所述制备的活性成分来处理甘蓝的幼苗。对照植物仅用丙酮/二甲基亚砜/**tween®**的水溶液进行处理。

[0608] 在72小时后,通过用寄生霜霉孢子的水性悬浮液喷洒叶片来污染植物。将污染的甘蓝植物在20°C和100%的相对湿度下温育5天。

[0609] 在温育5天后评估测试。0%表示对应于对照植物的功效,而100%的功效表示没有观察到病害。

[0610] 在该测试中,本发明的以下化合物在31ppm的活性成分浓度下显示出70%至79%的功效:I.01;I.04;I.26

[0611] 在该测试中,本发明的以下化合物在31ppm的活性成分浓度下显示出80%至89%的功效:I.10;I.14;I.17;I.33

[0612] 在该测试中,本发明的以下化合物在31ppm的活性成分浓度下显示出90%至100%的功效:I.02;I.09;I.13;I.15;I.23;I.28

[0613] 在该测试中,本发明的以下化合物在125ppm的活性成分浓度下显示出70%至79%

的功效:I.03

[0614] 在该测试中,本发明的以下化合物在125ppm的活性成分浓度下显示出80%至89%的功效:I.12;I.31;I.35;I.44

[0615] 在该测试中,本发明的以下化合物在125ppm的活性成分浓度下显示出90%至100%的功效:I.02;I.09;I.10;I.13;I.14;I.15;I.16;I.17;I.23;I.26;I.28;I.29;I.30;I.33;I.38;I.40;I.42。

[0616] 实施例G:对疣顶单胞锈菌 (Uromycesappendiculatus) (菜豆锈病) 的体内预防性测试

[0617] 通过在丙酮/二甲基亚砜/**tween®**的混合物中均质化来制备所测试的活性成分,然后用水稀释以获得所需的活性材料浓度。

[0618] 通过喷洒根据上文所述制备的活性成分来处理菜豆的幼苗。对照植物仅用丙酮/二甲基亚砜/**tween®**的水溶液进行处理。

[0619] 在72小时后,通过用疣顶单胞锈菌孢子的水性悬浮液喷洒叶片来污染植物。将污染的菜豆植物在20°C和100%的相对湿度下温育24小时,然后在20°C和70-80%相对湿度下温育9天。

[0620] 在温育10天后评估测试。0%表示对应于对照植物的功效,而100%的功效表示没有观察到病害。

[0621] 在该测试中,本发明的以下化合物在500ppm的活性成分浓度下显示出70%至79%的功效:I.03;I.05。

[0622] 在该测试中,本发明的以下化合物在500ppm的活性成分浓度下显示出80%至89%的功效:I.09。

[0623] 在该测试中,本发明的以下化合物在500ppm的活性成分浓度下显示出90%至100%的功效:I.01;I.02。

[0624] 实施例H:对菜豆炭疽病菌 (Colletotrichumlindemuthianum) 的体内预防性测试 (菜豆上的炭疽病)

[0625] 通过在丙酮/二甲基亚砜/**tween®**的混合物中均质化来制备所测试的活性成分,然后用水稀释以获得所需的活性材料浓度。

[0626] 通过喷洒根据上文所述制备的活性成分来处理菜豆的幼苗。对照植物仅用丙酮/二甲基亚砜/**tween®**的水溶液进行处理。

[0627] 在72小时后,通过用菜豆炭疽病菌孢子的水性悬浮液喷洒叶片来污染植物。将污染的菜豆植物在20°C和100%的相对湿度下温育24小时,然后在20°C和90%相对湿度下温育5天。

[0628] 在温育6天后评估测试。0%表示对应于对照植物的功效,而100%的功效表示没有观察到病害。

[0629] 在该测试中,本发明的以下化合物在500ppm的活性成分浓度下显示出70%至79%的功效:I.04。

[0630] 在该测试中,本发明的以下化合物在500ppm的活性成分浓度下显示出80%至89%的功效:I.09。

[0631] 在该测试中,本发明的以下化合物在500ppm的活性成分浓度下显示出90%至

100%的功效:I.02;I.03。

[0632] 在该测试中,本发明的以下化合物在31ppm的活性成分浓度下显示出70%至79%的功效:I.04;I.10;I.31;I.42。

[0633] 在该测试中,本发明的以下化合物在31ppm的活性成分浓度下显示出80%至89%的功效:I.14;I.15;I.33。

[0634] 在该测试中,本发明的以下化合物在31ppm的活性成分浓度下显示出90%至100%的功效:I.02;I.13。

[0635] 实施例 I: 对野油菜黄单胞菌野油菜致病变种 (Xanthomonas campestris pv. campestris) (甘蓝菜上的黑腐病) 的体内预防性测试

[0636] 通过在丙酮/二甲基亚砜/**tween®**的混合物中均质化来制备所测试的活性成分,然后用水稀释以获得所需的活性材料浓度。

[0637] 通过喷洒根据上文所述制备的活性成分来处理甘蓝的幼苗。对照植物仅用丙酮/二甲基亚砜/**tween®**的水溶液进行处理。

[0638] 在72小时后,通过用野油菜黄单胞菌野油菜致病变种的水性细菌悬浮液喷洒叶片来污染植物。将污染的甘蓝植物在27°C和95%的相对湿度下温育8天或10天。

[0639] 在温育8天或10天后评估测试。0%表示对应于对照植物的功效,而100%的功效表示没有观察到病害。

[0640] 在该测试中,本发明的以下化合物在125ppm的活性成分浓度下显示出70%至79%的功效:I.02;I.03;I.15;I.31;I.38;I.44。

[0641] 在该测试中,本发明的以下化合物在125ppm的活性成分浓度下显示出80%至89%的功效:I.23;I.30;I.45。

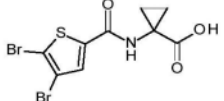
[0642] 在该测试中,本发明的以下化合物在125ppm的活性成分浓度下显示出90%至100%的功效:I.10;I.12;I.14;I.17;I.24;I.25;I.26;I.29;I.33;I.34;I.36;I.42。

[0643] 实施例J:比较实施例

[0644] 在与实施例E中所述的相同条件下,将化合物CMP1在番茄细菌性斑点病菌(番茄上的细菌性斑点病)的体内预防性测试中进行测试。

[0645] 化合物CMP1根据W02004/024692的教导进行制备。

[0646] 结果如下表所示。

实施例	结构	在 500 ppm 下的功效 (%)	在 125 ppm 下的功效 (%)
[0647] CMP1		0	0

[0648] 当在500ppm的浓度下测试时,本发明的式(I)的化合物显示出比结构上相关的化合物CMP1更好的功效。

[0649] 更具体而言,化合物I.02在500ppm的浓度下显示出至少90%的功效,而CMP1在相同浓度下显示出低于10%的功效。

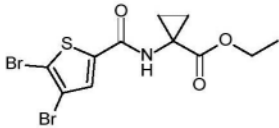
[0650] 当在125ppm的浓度下测试时,本发明的式(I)的化合物显示出比结构上相关的化合物CMP1更好的功效。

[0651] 更具体而言,化合物I.14在125ppm的浓度下显示出至少80%的功效,而CMP1在相同浓度下显示出低于10%的功效。

[0652] 在与实施例E中所述的相同条件下,将化合物CMP2在番茄细菌性斑点病菌(番茄上的细菌性斑点病)的体内预防性测试中进行测试。

[0653] 化合物CMP2根据W02004/024692的教导进行制备。

[0654] 结果如下表所示。

实施例	结构	在 125 ppm 下的功效 (%)
[0655] CMP2		0

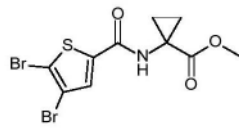
[0656] 当在125ppm的浓度下测试时,本发明的式(I)的化合物显示出比结构上相关的化合物CMP2更好的功效。

[0657] 更具体而言,化合物I.01、I.43和I.09在125ppm的浓度下显示出至少70%的功效,而CMP2在相同浓度下显示出低于10%的功效。

[0658] 在与实施例E中所述的相同条件下,将化合物CMP3在番茄细菌性斑点病菌(番茄上的细菌性斑点病)的体内预防性测试中进行测试。

[0659] 化合物CMP3根据W02004/024692的教导进行制备。

[0660] 结果如下表所示。

实施例	结构	在 31 ppm 下的功效 (%)
[0661]		
[0662] CMP3		3

[0663] 当在31ppm的浓度下测试时,本发明的式(I)的化合物显示出比结构上相关的化合物CMP3更好的功效。

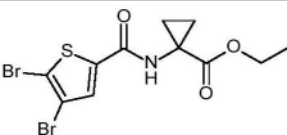
[0664] 更具体而言,化合物I.07、I.10、I.11和I.16在31ppm的浓度下显示出至少70%的功效,而CMP3在相同浓度下显示出低于10%的功效。

[0665] 实施例K:比较实施例

[0666] 在与实施例F中所述的相同条件下,将化合物CMP2在寄生霜霉(十字花科蔬菜霜霉病)的体内预防性测试中进行测试。

[0667] 化合物CMP2根据W02004/024692的教导进行制备。

[0668] 结果如下表所示。

实施例	结构	在 31 ppm 下的功效(%)
[0669] CMP2		0

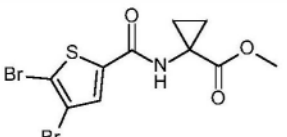
[0670] 当在31ppm的浓度下测试时,本发明的式(I)的化合物显示出比结构上相关的化合物CMP2更好的功效。

[0671] 更具体而言,化合物I.01和I.09在31ppm的浓度下显示出至少70%的功效,而CMP2在相同浓度下显示出低于10%的功效。

[0672] 在与实施例F中所述的相同条件下,将化合物CMP3在寄生霜霉(十字花科蔬菜霜霉病)的体内预防性测试中进行测试。

[0673] 化合物CMP3根据W02004/024692的教导进行制备。

[0674] 结果如下表所示。

实施例	结构	在 125 ppm 下的功效 (%)
[0675] CMP3		38

[0676] 当在125ppm的浓度下测试时,本发明的式(I)的化合物显示出比结构上相关的化合物CMP3更好的功效。

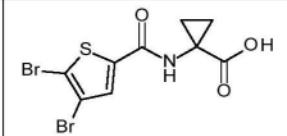
[0677] 更具体而言,化合物I.10和I.16在125ppm的浓度下显示出至少90%的功效,而CMP3在相同浓度下显示出低于40%的功效。

[0678] 实施例L:比较实施例

[0679] 在与实施例H中所述的相同条件下,将化合物CMP1在菜豆炭疽病菌(菜豆上的炭疽病)的体内预防性测试中进行测试。

[0680] 化合物CMP1根据W02004/024692的教导进行制备。

[0681] 结果如下表所示。

实施例	结构	在 31 ppm 下的功效(%)
[0682] CMP1		27*

[0683] *2次测试的算数平均值

[0684] 当在31ppm的浓度下测试时,本发明的式(I)的化合物显示出比结构上相关的化合物CMP1更好的功效。

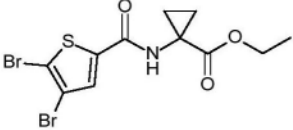
[0685] 更具体而言,化合物I.02、I.13和I.14在31ppm的浓度下显示出至少80%的功效,而CMP1在相同浓度下显示出低于30%的功效。

[0686] 在与实施例I中所述的相同条件下,将化合物CMP2在菜豆炭疽病菌(菜豆上的炭疽

病)的体内预防性测试中进行测试。

[0687] 化合物CMP2根据W02004/024692的教导进行制备。

[0688] 结果如下表所示。

实施例	结构	在 500 ppm 下的功效 (%)
[0689] CMP2		0

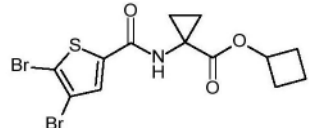
[0690] 当在500ppm的浓度下测试时,本发明的式(I)的化合物显示出比结构上相关的化合物CMP2更好的功效。

[0691] 更具体而言,化合物I.09在500ppm的浓度下显示出至少80%的功效,而CMP2在相同浓度下显示出低于10%的功效。

[0692] 在与实施例I中所述的相同条件下,将化合物CMP5在菜豆炭疽病菌(菜豆上的炭疽病)的体内预防性测试中进行测试。

[0693] 化合物CMP5根据W02004/024692的教导进行制备。

[0694] 结果如下表所示。

实施例	结构	在 31 ppm 下的功效(%)
[0695] CMP5		25

[0696] 当在31ppm的浓度下测试时,本发明的式(I)的化合物显示出比结构上相关的化合物CMP5更好的功效。

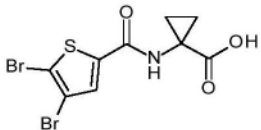
[0697] 更具体而言,化合物I.42在31ppm的浓度下显示出至少70%的功效,而CMP5在相同浓度下显示出低于30%的功效。

[0698] 实施例M:比较实施例

[0699] 在与实施例I中所述的相同条件下,将化合物CMP1在野油菜黄单胞菌野油菜致病变种(甘蓝菜上的黑腐病)的体内预防性测试中进行测试。

[0700] 化合物CMP1根据W02004/024692的教导进行制备。

[0701] 结果如下表所示。

实施例	结构	在 31 ppm 下的功效(%)
[0702] CMP1		10*

[0703] *2次测试的算数平均值

[0704] 当在31ppm的浓度下测试时,本发明的式(I)的化合物显示出比结构上相关的化合物CMP1更好的功效。

[0705] 更具体而言,化合物I.14在31ppm的浓度下显示出至少80%的功效,而CMP1在相同浓度下显示出10%的功效。