(19)中华人民共和国国家知识产权局

(12)发明专利
(全文更正)

(10)授权公告号 CN 103140136 B9
(48)更正文献出版日 2016.06.29
(45)授权公告日 2016.05.11

(21)申请号 201180041886.9
(22)申请日 2011.09.01
(30)优先权数据
61/378,982 2010.09.01 US
61/416,346 2010.11.23 US
61/438,356 2011.02.01 US
61/510,137 2011.07.21 US
(85)PCT国际申请进入国家阶段日
2013.02.28
(86)PCT国际申请的申请数据
PCT/US2011/050124 2011.09.01
(87)PCT国际申请的公布数据
WO2012/031061 EN 2012.03.08
(73)专利权人 杜邦公司
地址 美国特拉华
(72)发明人 J·K·朗 V·格雷戈里
S·古特里奇 A·E·塔吉
J·F·拜瑞兹耐克
(74)专利代理机构 永新专利商标代理有限公司
72002
代理人 张晓威
(51)Int.Cl.
A01N 43/48(2006.01)
(56)对比文件
CN 102421756 A,2012.04.18,
CN 1140449 A,1997.01.15,
US 6087381 A,2000.07.11,
US 2010016396 A1,2010.01.21,
审查员 李杨军

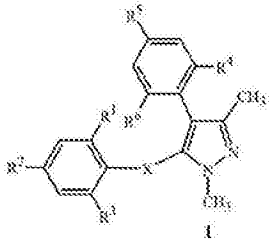
权利要求书6页 说明书131页

(54)发明名称

杀真菌吡唑以及它们的混合物

(57)摘要

本发明公开了杀真菌组合物，所述组合物包含(a)至少一种化合物，所述化合物选自式1的化合物、其N-氧化物及其盐，

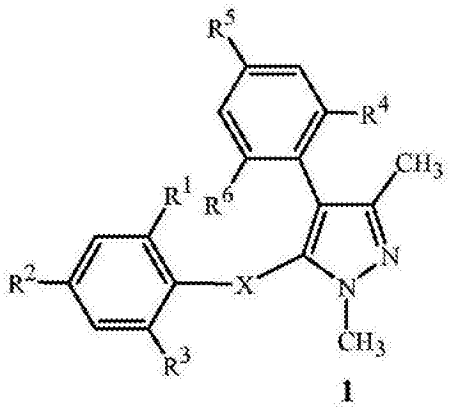


其中R^1、R^2、R^3、R^4、R^5和R^6如在公开中所定义；和(b)至少一种附加的杀真菌化合物。本发明还公开了用于控制由真菌植物病原体引起的植物病害的方法，所述方法包括向所述植物或其部分、或向植物种子施用杀真菌有效量的式1的化合物，其N-氧化物或其盐(如作为上述组合物中的组分)。还公开了组合物，所述组合物包含：(a)至少一种化合物，所述化合物选自上文所述式1的化合物、其N-氧化物及其盐；和至少一种无脊椎害虫控制化合物或试剂。

CN 103140136 B9

1. 杀真菌组合物，包含：

(a) 至少一种化合物，所述化合物选自式 1 的化合物及其盐：



1

其中

X 为 NH；

R^1 为卤素；

R^2 为 H；

R^3 为卤素；

R^4 为卤素；

R^5 为 H、氰基、卤素或 C_1-C_2 烷氧基；并且

R^6 为 H 或卤素；和

(b) 至少一种附加的杀真菌化合物，

前提条件是，当 R^1 为 F 时，则 R^3 为 Cl；并且当 R^1 为 Cl 时，则 R^3 为 F。

2. 根据权利要求 1 所述的组合物，其中组分 (a) 包含式 1 的化合物或其盐，其中在式 1 中，

最多仅 R^2 和 R^3 中的一者为 H；并且

最多仅 R^5 和 R^6 中的一者为 H。

3. 根据权利要求 2 所述的组合物，其中在式 1 中，

R^1 为 F、Cl 或 Br；

R^2 为 H；

R^3 为 F 或 Cl；

R^4 为 F、Cl 或 Br；

R^5 为 H、氰基、F、Cl 或甲氧基；并且

R^6 为 H 或 F。

4. 根据权利要求 3 所述的组合物，其中在式 1 中，

R^3 为 F；并且

R^5 为氰基、F、Cl 或甲氧基。

5. 根据权利要求 1 所述的组合物，其中组分 (a) 包含选自以下的化合物：

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-(2- 溴 -4- 氟苯基)-N-(2- 氯 -6- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺，

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-(2- 溴 -4- 氟苯基)-N-(2- 溴 -6- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺，

N-(2- 溴 -6- 氟苯基)-4-(2,4- 二氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺，

N-(2- 溴 -6- 氟苯基)-4-(2,6- 二氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺，

N-(2- 氯 -6- 氟苯基)-4-(2- 氟 -4- 甲氧苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺，

N-(2- 溴 -6- 氟苯基)-4-(2- 氟 -4- 甲氧苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺，

N-(2- 溴 -6- 氟苯基)-4-(2- 氯 -4- 甲氧苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺，和

N-(2- 氯 -6- 氟苯基)-4-(2,4- 二氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺。

6. 根据权利要求 1 至 5 中任一项所述的组合物，其中组分 (b) 包含至少一种选自以下的杀真菌化合物：

(b1) 苯并咪唑氨基甲酸甲酯杀真菌剂；

(b2) 二甲酰亚胺杀真菌剂；

(b3) 脱甲基抑制剂杀真菌剂；

(b4) 苯基酰胺杀真菌剂；

(b5) 胺 / 吗啉杀真菌剂；

(b6) 磷脂生物合成抑制剂杀真菌剂；

(b7) 羧酰胺杀真菌剂；

(b8) 羟基 (2- 氨基 -) 嘧啶杀真菌剂；

(b9) 苯胺嘧啶杀真菌剂；

(b10)N- 苯基氨基甲酸酯杀真菌剂；

(b11) 醌外部抑制剂杀真菌剂；

(b12) 苯基吡咯杀真菌剂；

(b13) 喹啉杀真菌剂；

(b14) 类脂过氧化抑制剂杀真菌剂；

(b15) 黑素生物合成抑制剂 - 还原酶杀真菌剂；

(b16) 黑素生物合成抑制剂 - 脱水酶杀真菌剂；

(b17) 羟基苯胺杀真菌剂；

(b18) 角鲨烯 - 环氧酶抑制剂杀真菌剂；

(b19) 多抗霉素杀真菌剂；

(b20) 苯基脲杀真菌剂；

(b21) 醌内部抑制剂杀真菌剂；

(b22) 苯甲酰胺杀真菌剂；

(b23) 烯醇吡喃糖醛酸抗生素杀真菌剂；

(b24) 己吡喃糖基抗生素杀真菌剂；

(b25) 吡喃葡糖基抗生素 :蛋白质合成杀真菌剂；

(b26) 吡喃葡糖基抗生素 :海藻糖酶和肌醇生物合成杀真菌剂；

(b27) 氰基乙酰胺肟杀真菌剂；

(b28) 氨基甲酸酯杀真菌剂；

(b29) 氧化磷酸化解偶杀真菌剂；

(b30) 有机锡杀真菌剂；

(b31) 羧酸杀真菌剂；

(b32) 杂芳族杀真菌剂；

(b33) 膦酸酯杀真菌剂；

(b34) 酞氨酸杀真菌剂；

(b35) 苯并三嗪杀真菌剂；

(b36) 苯-磺酰胺杀真菌剂；

(b37) 哒嗪酮杀真菌剂；

(b38) 噻吩-羧酰胺杀真菌剂；

(b39) 嘧啶酰胺杀真菌剂；

(b40) 羧酸酰胺杀真菌剂；

(b41) 四环素抗生素杀真菌剂；

(b42) 硫代氨基甲酸酯杀真菌剂；

(b43) 苯甲酰胺杀真菌剂；

(b44) 寄主植物防御诱导型杀真菌剂；

(b45) 多位点接触活性杀真菌剂；

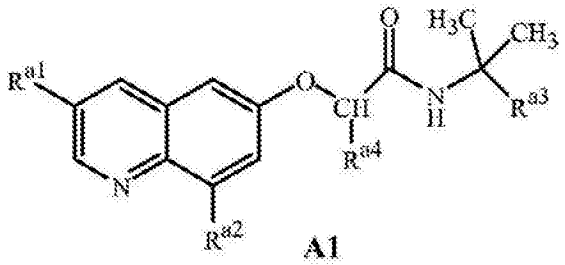
(b46) 杀真菌化合物，所述杀真菌化合物不是组分 (a) 和组分 (b1) 至 (b45) 的杀真菌化合物；以及 (b1) 至 (b46) 的化合物的盐。

7. 根据权利要求6所述的组合物，其中组分 (b) 包含至少一种杀真菌化合物，所述杀真菌化合物来自选自 (b1) 至 (b46) 的两个不同组中的每一组。

8. 根据权利要求1所述的组合物，其中组分 (b) 包含至少一种选自以下的化合物：苯并噻二唑-S-甲基、4-十二烷基-2,6-二甲基吗啉 (aldimorph)、辛唑嘧菌胺 (ametoctradin)、吲唑磺菌胺、敌菌灵、戊环唑、嘧菌酯、苯霜灵、苯霜灵-M、麦锈灵、苯菌灵、苯噻菌胺、异丙基苯噻菌胺、3-苯并[b]噻吩-2-基-5,6-二氢-1,4,2-噁噻嗪 4-氧化物 (bethoxazin)、乐杀螨、联苯、双苯三唑醇、联苯吡菌胺 (bixafen)、杀稻瘟菌素-S、啶酰菌胺、糠菌唑、乙嘧酚磺酸酯、萎锈灵、环丙酰菌胺、敌菌丹、克菌丹、多菌灵、地茂散、百菌清、乙菌利、克霉唑、铜盐、赛座灭、环氟菌胺、霜脲氰、环丙唑醇、嘧菌环胺、抑菌灵、双氯氰菌胺、哒菌清、氯硝胺、乙霉威、恶醚唑、二氟林、甲菌定、烯酰吗啉、醚菌胺、烯唑醇、烯唑醇-M、敌螨普、二噻农、十二环吗啉、多果定、敌瘟磷、烯肟菌酯、氟环唑、噻唑菌胺、乙嘧酚、土菌灵、㗁唑菌酮、咪唑菌酮、氯苯嘧啶醇、腈苯唑、甲呋酰苯胺、环酰菌胺、氰菌胺、拌种咯、苯锈啶、丁苯吗啉、胺苯吡菌酮、三苯基乙酸锡、三苯基氯化锡、三苯基氢氧化锡、福美铁、嘧菌腙、氟啶胺、咯菌腈、氟酰菌胺、氟吗啉、氟吡菌胺、氟吡菌酰胺、氟酰亚胺、氟嘧菌酯、氟喹唑、氟硅唑、磺菌胺、氟噻菌净、氟酰胺、粉唑醇、氟苯吡菌胺 (fluxapyroxad)、灭菌丹、三乙膦酸铝、麦穗宁、呋霜灵、福拉比、己唑醇、恶霉灵、克热净、抑霉唑、酰胺唑、双胍辛胺、碘代丙炔基丁基氨基甲酸酯 (iodocarb)、种菌唑、异稻瘟净、异菌脲、丙森锌、稻瘟灵、萘吡菌胺 (isopyrazam)、异噻菌胺、春雷霉素、克收欣、代森锰锌、双炔酰菌胺、代森锰、灭锈胺、消螨普、甲霜灵、甲霜灵-M、叶菌唑、磺菌威、代森联、苯氧菌胺、嘧菌胺、苯菌酮、腈菌唑、奈替芬、甲肿铁铵、甲基肿酸铁、氟苯嘧啶醇、辛噻酮、呋酰胺、肟醚菌胺、恶霜灵、㗁喹酸、㗁咪唑、氧化萎锈灵、氧四环素、戊菌唑、戊菌隆、戊苯吡菌胺、吡噻菌胺、稻瘟酯、亚磷酸及其盐、苯酞、啶氧菌酯、粉病灵、多抗霉素、烯丙异噻唑、咪鲜安、腐霉利、霜霉威、霜霉威-盐酸

盐、丙环唑、丙森锌、丙氧喹啉、硫菌威、丙硫菌唑、唑菌胺酯、唑胺菌酯、唑菌酯、定菌磷、吡菌苯威 (pyribencarb)、稗草畏、啶斑肟、嘧霉胺、甲氧苯啶菌 (pyriofenone)、咯喹酮、硝吡咯菌素、灭螨猛、快诺芬、五氯硝基苯、环丙吡菌胺 (sedaxane)、硅噻菌胺、硅氟唑、螺环菌胺、链霉素、硫、戊唑醇、异丁乙氧喹啉 (tebufloquin)、克枯烂、四氯硝基苯、特比萘芬、氟醚唑、噻菌 灵、噻呋灭、托布津、甲基硫菌灵、二硫四甲秋兰姆、噻酰菌胺、甲基立枯磷、对甲抑菌灵、三唑酮、三唑醇、唑菌嗪、十三吗啉、氟菌唑、三环唑、肟菌酯、嗪氨灵、垂吗酰胺、灭菌唑、烯效唑、井冈霉素、霜霉灭、乙烯菌核利、代森锌、福美锌、苯酰菌胺 (zoxamide)、N'-[4-[4- 氯 -3-(三氟甲基) 苯氧基]-2,5- 二甲基苯基]-N- 乙基 -N- 甲基甲亚胺酰胺、5- 氯 -6-(2,4,6- 三氟苯基)-7-(4- 甲基哌啶 -1- 基)[1,2,4] 三唑并 [1,5-a] 嘧啶、N-[2-[4-[[3-(4- 氯苯基)-2- 丙炔 -1- 基] 氧]-3- 甲氧苯基] 乙基]-3- 甲基 -2-[(甲磺酰) 氨基] 丁酰胺、N-[2-[4-[[3-(4- 氯苯基)-2- 丙炔 -1- 基] 氧]-3- 甲氧苯基] 乙基]-3- 甲基 -2-[(乙基磺酰基) 氨基] 丁酰胺、2- 丁氧基 -6- 碘 -3- 丙基 -4H-1- 苯并吡喃 -4- 酮、3-[5-(4- 氯苯基)-2,3- 二甲基 -3- 异▒唑啉基] 吡啶、N-[1-[[[1-(4- 氰基苯基) 乙基] 磺酰基] 甲基] 丙基] 氨基甲酸 -4- 氟苯酯、N-[[(环丙基甲氧基) 氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3- 二氟苯基] 亚甲基] 苯乙酰胺、α -(甲氧基亚氨基)-N- 甲基 -2-[[[1-[3-(三氟甲基) 苯基] 乙氧基] 亚氨基] 甲基] 苯乙酰胺、N'-[4-[4- 氯 -3-(三氟甲基) 苯氧基]-2,5- 二甲基苯基]-N- 乙基 -N- 甲基甲亚胺酰胺、N-(4- 氯 -2- 硝基苯基)-N- 乙基 -4- 甲基苯磺酰胺、2-[[[[3-(2,6- 二氯苯基)-1- 甲基 -2- 丙烯 -1- 亚基] 氨基] 氧] 甲基]-α -(甲氧基亚氨基)-N- 甲基苯乙酰胺、1-[(2- 丙烯硫基) 羰基]-2-(1- 甲基乙基)-4-(2- 甲基苯基)-5- 氨基 -1H- 吡唑 -3- 酮、5- 乙基 -6- 辛基 -[1,2,4] 三唑并 [1,5-a] 嘧啶 -7- 基胺、N-[4-[[[[(1- 甲基 -1H- 四唑 -5- 基) 苯基亚甲基] 氨基] 氧] 甲基]-2- 噻唑基] 氨基甲酸戊酯和 N-[6-[[[[(1- 甲基 -1H- 四唑 -5- 基) 苯基亚甲基] 氨基] 氧] 甲基]-2- 吡啶基] 氨基甲酸戊酯。

9. 根据权利要求 1 所述的组合物，其中组分 (b) 包含至少一种杀真菌化合物，所述杀真菌化合物选自式 A1 的化合物及其盐



A1

其中

R^{a1} 为卤素，C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 炔基；

R^{a2} 为 H、卤素或 C_1-C_4 烷基；

R^{a3} 为 C_1-C_{12} 烷基、C_1-C_{12} 卤代烷基、C_1-C_{12} 烷氧基、C_2-C_{12} 烷氧基烷基、C_2-C_{12} 烯基、C_2-C_{12} 炔基、C_4-C_{12} 烷氧基烯基、C_4-C_{12} 烷氧基炔基、C_1-C_{12} 烷硫基或 C_2-C_{12} 烷硫基烷基；

R^{a4} 为甲基或 Y^{a1}-R^{a5}；

R^{a5} 为 C_1-C_2 烷基；并且

Y^{a1} 为 CH_2、O 或 S。

10. 根据权利要求 1 所述的组合物，其中组分 (a) 为 4-(2- 溴 -4- 氟苯基)-N-(2- 氯 -6- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺。

11. 根据权利要求 1 所述的组合物，其中组分 (a) 为 4-(2- 溴 -4- 氟苯基)-N-(2- 氯 -6- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺；并且组分 (b) 包括至少一种选自以下的化合物：嘧菌酯、克收欣、肟菌酯、唑菌胺酯、唑菌酯、唑胺菌酯、啶氧菌酯、醚菌胺、苯氧菌胺、多菌灵、百菌清、快诺芬、苯菌酮、甲氧苯啶菌、环氟菌胺、苯锈啶、丁苯吗啉、糠菌唑、环丙唑醇、恶醚唑、氟环唑、腈苯唑、氟硅唑、己唑醇、种菌唑、叶菌唑、腈菌唑、戊菌唑、丙环唑、丙氧喹啉、丙硫菌唑、戊唑醇、灭菌唑、[illegible]唑菌酮、咪鲜安、吡噻菌胺和啶酰菌胺。

12. 根据权利要求 1 或 11 所述的组合物，其中组分 (b) 包括至少一种选自以下的化合物：百菌清、叶菌唑、丙硫菌唑和吡噻菌胺。

13. 组合物，包含：(a) 至少一种化合物，所述化合物选自如权利要求 1 中所定义的式 1 的化合物及其盐；和至少一种无脊椎害虫控制化合物或试剂。

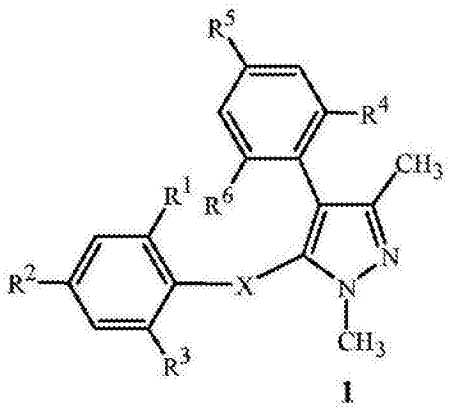
14. 组合物，包含权利要求 1 至 13 中任一项的组合物和至少一种附加组分，所述附加组分选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂。

15. 保护植物或植物种子免受由真菌病原体引起的病害的方法，包括向植物或植物种子施用杀真菌有效量的权利要求 1 至 14 中任一项的组合物。

16. 保护植物免受白粉病病害的方法，包括向植物施用杀真菌有效量的权利要求 1 至 5 中任一项的组合物，其中组分 (b) 包含至少一种选自 (b11) 醌外部抑制剂杀真菌剂的杀真菌化合物。

17. 保护植物免受壳针孢属病害的方法，包括向植物施用杀真菌有效量的权利要求 9 的组合物。

18. 式 1 的化合物或其盐，



I

其中

X 为 NH；

R^1 为卤素；

R^2 为 H；

R^3 为卤素；

R^4 为卤素；

R^5 为 H、氰基、卤素或 C_1-C_2 烷氧基；并且

R^6 为 H 或卤素；

前提条件是，当 R^1 为 F 时，则 R^3 为 Cl，并且当 R^1 为 Cl 时，则 R^3 为 F。

19. 根据权利要求 18 所述的化合物，其中 R^3 为 F 或 Cl。

20. 根据权利要求 19 所述的化合物，其中 R^1 为 Cl 或 Br ；并且 R^3 为 F。

21. 根据权利要求 18 所述的化合物，所述化合物选自：

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-(2- 溴 -4- 氟苯基)-N-(2- 氯 -6- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺和

N-(2- 溴 -6- 氟苯基)-4-(2- 氯 -4- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺。

22. 根据权利要求 18 所述的化合物，所述化合物为 4-(2- 溴 -4- 氟苯基)-N-(2- 氯 -6- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺。

23. 杀真菌组合物，包含 :(1) 权利要求 18 至 22 中任一项的化合物 ;和 (2) 至少一种附加组分，所述附加组分选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂。

24. 保护植物或植物种子免受由真菌病原体引起的病害的方法，包括向植物或植物种子施用杀真菌有效量的权利要求 18 至 22 中任一项的化合物。

杀真菌吡唑以及它们的混合物

技术领域

[0001] 本发明涉及某些吡唑衍生物、它们的 N- 氧化物和盐，并且涉及包含此类吡唑衍生物的混合物和组合物，以及使用此类吡唑衍生物及它们的混合物和组合物作为杀真菌剂的方法。

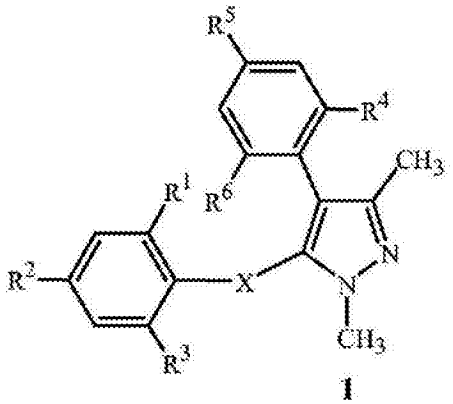
背景技术

[0002] 为获得高农作物效率，控制植物病原真菌引起的植物病害是极其重要的。对观赏作物、蔬菜作物、大田作物、谷类作物和果树作物有损害的植物病害会造成产量显著降低，从而导致消费成本上升。除通常具有高破坏性以外，植物病害还难以控制，并且可发展出对商业杀真菌剂的抗性。为此目的，许多产品可商购获得，但是持续需要更有效、更经济、对环境更安全或具有不同作用位点的新型杀真菌化合物。除了引入新型杀真菌剂以外，杀真菌剂的组合通常被用于促进病害控制，以拓宽控制范围并延缓抗性发展。此外，杀真菌剂的某些优秀组合表现出超出加合的（即协同）功效，从而提供具有重要商业价值的植物病害控制度。本领域认识到，具体杀真菌剂组合的优点将根据以下这些因素而不同：具体的植物品种和待治疗的植物病害、以及在感染植物病原真菌之前还是之后治疗植物。因此，需要新型的有利组合来提供多种选择，以最大程度地满足具体的植物病害控制需求。此类组合现已被发现。JP08208620 公开了 N- 苯基吡唑基胺衍生物作为杀昆虫剂、除草剂和杀真菌剂；然而，本发明的杀真菌吡唑以及它们的混合物未公开于该公布中。

发明内容

[0003] 本发明涉及杀真菌组合物（即，组合），所述组合物包含（a）至少一种化合物，所述化合物选自式 1 的化合物（包括所有的立体异构体）、其 N- 氧化物及其盐：

[0004]



1

[0005] 其中

[0006] X 为 CHOH、O 或 NH；

[0007] R^1 为卤素或甲基；

[0008] R^2 为 H、氰基、卤素或 C_1-C_2 烷氧基；

[0009] R^3 为 H、卤素或甲基；

[0010] R^4 为卤素；

[0011] R^5 为 H、氰基、卤素或 C_1-C_2 烷氧基；并且

[0012] R^6 为 H 或卤素；和

[0013] (b) 至少一种附加的杀真菌化合物。

[0014] 本发明还涉及组合物，所述组合物包含：(a) 至少一种化合物，所述化合物选自上文所述式 1 的化合物、其 N- 氧化物及其盐；和至少一种无脊椎害虫控制化合物或试剂。

[0015] 本发明还涉及包含上述组合物中的一种的组合物，所述前述组合物包含组分 (a) 和至少一种附加组分，所述附加组分选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂。

[0016] 本发明还涉及用于控制由植物病原真菌引起的植物病害的方法，所述方法包括向植物或其部分或向植物种子施用杀真菌有效量的上述组合物中的一种。

[0017] 前述方法还可描述为保护植物或植物种子免受由真菌病原体引起的病害的方法，所述方法包括向植物 (或其部分) 或植物种子施用杀真菌有效量的上述组合物中的一种 (直接施用到植物或植物种子上，或通过环境 (例如生长介质) 施用)。

[0018] 本发明还涉及上述式 1 的化合物、或其 N- 氧化物或其盐。本发明还涉及杀真菌组合物，所述组合物包含式 1 的化合物、或其 N- 氧化物或其盐和至少一种附加组分，所述附加组分选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂。本发明并且还涉及保护植物或植物种子免受由真菌病原体引起的病害的方法，所述方法包括向植物或植物种子施用杀真菌有效量的式 1 的化合物、或其 N- 氧化物或其盐。

具体实施方式

[0019] 如本文所用，术语“包括”、“包含”、“内含”、“涵盖”、“具有”、“含有”、“包容”、“容纳”、“特征在于”或其任何其它变型旨在涵盖非排他性的包括，以任何明确指明的限定为条件。例如，包含一系列元素的组合物、混合物、工艺或方法不必仅限于那些元素，而是可以包括未明确列出的其它元素，或此类组合物、混合物、工艺或方法的其它固有元素。

[0020] 连接短语“由…组成”不包括任何未指定的元素、步骤或成分。如果是在权利要求中，则此类词限制权利要求，以不包含除了通常与之伴随的杂质以外不是所述那些的物质。当短语“由 ... 组成”出现在权利要求主体的条款中，而不是紧接前言之后，则它仅限制此条款中描述的元素；其它元素未被排除在作为整体的权利要求之外。

[0021] 连接短语“基本上由…组成”用于限定组合物或方法，所述组合物或方法除了字面公开的那些以外，还包括物质、步骤、部件、组分或元素，前提条件是，这些附加的物质、步骤、部件、组分或元素不在很大程度上影响受权利要求书保护的本发明的基本特征和一种或多种新型特征。术语“基本上由 ... 组成”居于“包含”和“由 ... 组成”的中间。

[0022] 当申请人已经用开放式术语如“包含”定义了本发明或其一部分，则应易于理解 (除非另外指明)，说明书应被解释为还使用术语“基本上由 ... 组成”或“由 ... 组成”描述本发明。

[0023] 此外，除非有相反的明确说明，“或”是指包含性的“或”，而不是指排他性的“或”。例如，以下任何一个均表示满足条件 A 或 B：A 是真的 (或存在的) 且 B 是假的 (或不存在的)、A 是假的 (或不存在的) 且 B 是真的 (或存在的)、以及 A 和 B 都是真的 (或存在的)。

[0024] 同样，涉及元素或组分例证（即出现）次数的位于本发明元素或组分前的不定冠词“一个”或“一种”旨在是非限制性的。因此，应将“一个”或“一种”理解为包括一个或至少一个，并且元素或组分的词语单数形式也包括复数形式，除非有数字明显表示单数。

[0025] 如本发明公开和权利要求中所述，“植物”包括所有生命阶段的植物界成员，尤其是种子植物（裸子植物），所述生命阶段包括植物幼体阶段（例如发芽的种子发育成秧苗）和成熟繁殖阶段（例如开花和结种的植物）。植物部分包括通常生长在成长介质（例如土壤）表面以下的向地性部分诸如根、块茎、鳞茎和球茎，以及在生长介质以上生长的部分诸如叶（包括茎和叶）、花、果实和种子。

[0026] 如本文所述，单独使用或与词语组合使用的术语“秧苗”是指由种子胚胎发育的植物幼体。

[0027] 在上文详述中，术语“烷氧基”包括例如甲氧基和乙氧基。术语“卤素”包括氟、氯、溴或碘。

[0028] 取代基中的碳原子总数由“C_i-C_j”前缀表示，其中 i 和 j 为 1 至 2 的数。

[0029] 与组合物和本发明的方法相关的化合物可以一种或多种立体异构体存在。多种立体异构体包括对映体、非对映体、阻转异构体和几何异构体。本领域的技术人员将会知道，当一种立体异构体相对于其它立体异构体富集时，或当其与其它立体异构体分离时，其可能更有活性和/或可能表现出有益的效果。另外，本领域的技术人员知道如何分离、富集和/或选择性地制备所述立体异构体。本发明组合物中的化合物可作为立体异构体的混合物、单独的立体异构体或作为旋光活性的形式存在。

[0030] 用于制备诸如吡唑的杂环 N- 氧化物的合成方法是本领域技术人员熟知的，包括使用过氧酸（如过乙酸和间氯过氧苯甲酸（MCPBA））、过氧化氢、烷基氢过氧化物（如叔丁基氢过氧化物）、过硼酸钠和双环氧乙烷（如二甲基双环氧乙烷）氧化杂环。制备 N- 氧化物的这些方法已被广泛描述和综述于文献中，参见例如 :T.L.Gilchrist 的 Comprehensive Organic Synthesis，第 7 卷，第 748-750 页，S.V.Ley 编辑，Pergamon Press ;M.Tisler 和 B.Stanovnik 的 Comprehensive Heterocyclic Chemistry，第 3 卷，第 18-20 页，A.J.Boulton 和 A.McKillop 编辑，Pergamon Press ;M.R.Grimmett 和 B.R.T.Keene 的 Advances in Heterocyclic Chemistry，第 43 卷，第 149-161 页，A.R.Katritzky 编辑，Academic Press ;M.Tisler 和 B.Stanovnik 的 Advances in Heterocyclic Chemistry，第 9 卷，第 285-291 页，A.R.Katritzky 和 A.J.Boulton 编辑，Academic Press ；以及 G.W.H.Cheeseman 和 E.S.G.Werstiuk 的 Advances in Heterocyclic Chemistry，第 22 卷，第 390-392 页，A.R.Katritzky 和 A.J.Boulton 编辑，Academic Press。

[0031] 本领域的技术人员认识到，由于在环境和生理条件下化合物的盐与它们相应的非盐形式处于平衡，因此盐与非盐形式分享生物用途。因此，单独和在混合物中的式 1 的化合物的各种盐可用于防治由植物病原真菌引起的植物病害（即为适用于农学的）。式 1 的化合物的盐包括与无机酸或有机酸形成的酸加成盐，所述酸如氢溴酸、盐酸、硝酸、磷酸、硫酸、乙酸、丁酸、富马酸、乳酸、马来酸、丙二酸、草酸、丙酸、水杨酸、酒石酸、4- 甲苯磺酸、或戊酸。因此，本发明涉及化合物的混合物，所述化合物选自式 1、其 N- 氧化物及其农业上适宜的盐。

[0032] 选自式 1、其立体异构体、互变异构体、N- 氧化物和盐的化合物通常以多于一种形

式存在，并且因此式 1 包括式 1 表示的所有结晶和非结晶形式的化合物。非结晶形式包括为固体的实施例如蜡和树胶，以及为液体的实施例如溶液和熔融物。结晶形式包括代表基本上单一晶型体的实施例以及代表多晶型体(即不同晶型)混合物的实施例。术语“多晶型体”涉及可以不同晶型结晶的化合物具体晶型，这些晶型在晶格中具有不同的分子排列和 / 或构象。虽然多晶型体可具有相同的化学组成，但是它们也可具有不同的组成，这应决定于是否存在微弱或强力键合于晶格内的共结晶的水 或其它分子。多晶型体可具有不同的化学、物理和生物特性，如结晶形状、密度、硬度、颜色、化学稳定性、熔点、吸湿性、可悬浮性、溶解率和生物利用度。本领域的技术人员将会知道，相对于由式 1 表示的相同化合物的另一种多晶型体或多晶型体混合物，由式 1 表示的化合物的多晶型体可显示出有益效果(例如制备可用制剂的适宜性，经改善的生物性能)。制备和分离由式 1 表示的化合物的特定多晶型体可通过本领域技术人员已知的方法实现，包括例如采用所选溶剂和温度进行结晶。

[0033] 如在发明内容中所述，本发明的一个方面涉及组合物，所述组合物包含(a)至少一种化合物，所述化合物选自式 1、其 N- 氧化物及其盐，和(b)至少一种附加的杀真菌化合物。更具体地，组分(b)选自

[0034] (b1)苯并咪唑氨基甲酸甲酯(MBC)杀真菌剂；

[0035] (b2)二甲酰亚胺杀真菌剂；

[0036] (b3)脱甲基抑制剂(DMI)杀真菌剂；

[0037] (b4)苯基酰胺杀真菌剂；

[0038] (b5)胺 / 吗啉杀真菌剂；

[0039] (b6)磷脂生物合成抑制剂杀真菌剂；

[0040] (b7)羧酰胺杀真菌剂；

[0041] (b8)羟基(2- 氨基 -)嘧啶杀真菌剂；

[0042] (b9)苯胺嘧啶杀真菌剂；

[0043] (b10)N- 苯基氨基甲酸酯杀真菌剂；

[0044] (b11)醌外部抑制剂(QoI)杀真菌剂；

[0045] (b12)苯基吡咯杀真菌剂；

[0046] (b13)喹啉杀真菌剂；

[0047] (b14)类脂过氧化抑制剂杀真菌剂；

[0048] (b15)黑素生物合成抑制剂 - 还原酶(MBI-R)杀真菌剂；

[0049] (b16)黑素生物合成抑制剂 - 脱水酶(MBI-D)杀真菌剂；

[0050] (b17)羟基苯胺杀真菌剂；

[0051] (b18)角鲨烯 - 环氧酶抑制剂杀真菌剂；

[0052] (b19)多抗霉素杀真菌剂；

[0053] (b20)苯基脲杀真菌剂；

[0054] (b21)醌内部抑制剂(QiI)杀真菌剂；

[0055] (b22)苯甲酰胺杀真菌剂；

[0056] (b23)烯醇吡喃糖醛酸抗生素杀真菌剂；

[0057] (b24)己吡喃糖基抗生素杀真菌剂；

[0058] (b25)吡喃葡糖基抗生素 :蛋白质合成杀真菌剂；

[0059] （b26）吡喃葡糖基抗生素：海藻糖酶和肌醇生物合成杀真菌剂；

[0060] （b27）氰基乙酰胺肟杀真菌剂；

[0061] （b28）氨基甲酸酯杀真菌剂；

[0062] （b29）氧化磷酸化解偶杀真菌剂；

[0063] （b30）有机锡杀真菌剂；

[0064] （b31）羧酸杀真菌剂；

[0065] （b32）杂芳族杀真菌剂；

[0066] （b33）膦酸酯杀真菌剂；

[0067] （b34）酞氨酸杀真菌剂；

[0068] （b35）苯并三嗪杀真菌剂；

[0069] （b36）苯－磺酰胺杀真菌剂；

[0070] （b37）哒嗪酮杀真菌剂；

[0071] （b38）噻吩－羧酰胺杀真菌剂；

[0072] （b39）嘧啶酰胺杀真菌剂；

[0073] （b40）羧酸酰胺（CAA）杀真菌剂；

[0074] （b41）四环素抗生素杀真菌剂；

[0075] （b42）硫代氨基甲酸酯杀真菌剂；

[0076] （b43）苯甲酰胺杀真菌剂；

[0077] （b44）寄主植物防御诱导型杀真菌剂；

[0078] （b45）多位点接触活性杀真菌剂；

[0079] （b46）杀真菌剂，所述杀真菌剂不是组分（a）和组分（b1）至（b45）的杀真菌剂；以及

[0080] （b1）至（b46）的化合物的盐。

[0081] 值得注意的是，在实施例中，组分（b）包含至少一种杀真菌化合物，所述杀真菌化合物来自选自（b1）至（b46）的两个不同组中的每一组。

[0082] “苯并咪唑氨基甲酸甲酯（MBC）杀真菌剂（b1）”（杀菌剂抗性行动委员会（FRAC）编码 1）通过在微管组装期间与 β－微管蛋白结合来抑制有丝分裂。抑制微管组装可扰乱细胞分裂、在细胞和细胞结构内的传输。苯并咪唑氨基甲酸甲酯杀真菌剂包括苯并咪唑和托布津杀真菌剂。苯并咪唑类包括苯菌灵、多菌灵、麦穗宁和噻菌灵。托布津类包括托布津和甲基硫菌灵。

[0083] “二甲酰亚胺杀真菌剂（b2）”（FRAC 编码 2）旨在通过干扰 NADH 细胞色素 c 还原酶来抑制真菌内的类脂过氧化。实例包括乙菌利、异菌脲、腐霉利和乙烯菌核利。

[0084] “脱甲基抑制剂（DMI）杀真菌剂（b3）”（FRAC 编码 3）抑制在甾醇制备中起作用的 C14- 脱甲基酶。甾醇诸如麦角固醇是薄膜结构和功能所需的，使得它们是产生功能性细胞壁所必不可少的。因此，与这些杀真菌剂接触导致致敏真菌异常生长并且最终死亡。DMI 杀真菌剂分为多种化学类别：唑类（包括三唑类和咪唑类）、嘧啶类、哌嗪类和吡啶类。三唑类包括戊环唑、双苯三唑醇、糠菌唑、环丙唑醇、恶醚唑、烯唑醇（包括烯唑醇 -M）、氟环唑、乙环唑、腈苯唑、氟喹唑、氟硅唑、粉唑醇、己唑醇、酰胺唑、种菌唑、叶菌唑、腈菌唑、戊菌唑、丙环唑、丙硫菌唑、喹唑、硅氟唑、戊唑醇、氟醚唑、三唑酮、三唑醇、灭菌唑和烯效唑。咪唑类包

括克霉唑、益康唑、抑霉唑、异康唑、咪康唑、[illegible]咪唑、咪鲜胺、稻瘟酯和氟菌唑。嘧啶类包括氯苯嘧啶醇、氟苯嘧啶醇和嘧菌醇。哌嗪类包括嗪氨灵。吡啶类包括丁赛特和啶斑肟。生物化学调查研究已显示所有上述杀真菌剂为 DMI 杀真菌剂，如由 K.H.Kuck 等人在 Modern Selective Fungicides-Properties,Applications and Mechanisms of Action,H.Lyr(编辑)Gustav FischerVerlag :New York,1995,205-258）中所述。

[0085] “苯基酰胺杀真菌剂(b4)”(FRAC 编码 4)是卵菌真菌中 RNA 聚合酶的特定抑制剂。与这些杀真菌剂接触的致敏真菌显示出将尿核苷引入 rRNA 中的能力的下降。通过与该杀真菌剂接触，可阻止致敏真菌的生长 和发展。苯基酰胺杀真菌剂包括酰基丙氨酸、[illegible]唑烷酮和丁内酯杀真菌剂。所述酰基丙氨酸包括苯霜灵、苯霜灵 -M、呋霜灵、甲霜灵、甲霜灵 -M(也已知为甲霜灵)。[illegible]唑烷酮类包括恶霜灵。丁内酯类包括呋酰胺。

[0086] (b5)“胺 / 吗啉杀真菌剂”(FRAC 编码 5)抑制甾醇生物合成途径中的两个目标位点，$\Delta^8 \rightarrow \Delta^7$ 异构酶和 Δ^{14} 还原酶。甾醇诸如麦角固醇是薄膜结构和功能所需的，使得它们是产生功能性细胞壁所必不可少的。因此，其与这些杀真菌剂接触导致致敏真菌异常生长并且最终死亡。胺 / 吗啉杀真菌剂(还被称为非 -DMI 甾醇生物合成抑制剂)包括吗啉、哌啶和螺酮缩醇 - 胺杀真菌剂。吗啉类包括杀螟丹、十二环吗啉、丁苯吗啉、十三吗啉和垂吗酰胺。哌啶类包括苯锈啶和粉病灵。螺酮缩醇 - 胺类包括螺环菌胺。

[0087] “磷脂生物合成抑制剂杀真菌剂(b6)”(FRAC 编码 6)通过影响磷脂生物合成来抑制真菌的生长。磷脂生物合成杀真菌剂包括硫代磷酸酯和二硫戊环杀真菌剂。硫代磷酸酯类包括敌瘟磷、异稻瘟净和定菌磷。二硫戊环类包括稻瘟灵。

[0088] “羧酰胺杀真菌剂(b7)”(FRAC 编码 7)通过扰乱克雷伯氏循环(TCA 循环)中称为琥珀酸脱氢酶的关键性酶来抑制复合物 II (琥珀酸脱氢酶)真菌的呼吸。抑制呼吸可阻止真菌产生 ATP，从而抑制生长和繁殖。羧酰胺杀真菌剂包括苯甲酰胺、呋喃羧酰胺、氧硫杂环己二烯羧酰胺、噻唑羧酰胺、吡唑羧酰胺和吡啶羧酰胺。苯甲酰胺类包括麦锈灵、氟酰胺和灭锈胺。呋喃羧酰胺类包括甲呋酰苯胺。氧硫杂环己二烯羧酰胺类包括萎锈灵和氧化萎锈灵。噻唑羧酰胺类包括噻呋灭。所述吡唑羧酰胺类包括广谱杀菌剂、福拉比、萘吡菌胺(isopyrazam)、氟苯吡菌胺(fluxapyroxad)、吡噻菌胺、环丙吡菌胺(sedaxane)(N-[2-(1S,2R)-[1,1'- 联环丙烷]-2- 基苯基]-3-(二氟甲基)-1- 甲基 -1H- 吡唑 -4- 羧酰胺)和戊苯吡菌胺(penflufen)(N-[2-(1,3- 二甲基丁基) 苯基]-5- 氟 -1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -4- 羧酰胺)(PCT 专利公布 WO2003/010149)。吡啶羧酰胺类包括啶酰菌胺。

[0089] “羟基(2- 氨基 -)嘧啶杀真菌剂(b8)”(FRAC 编码 8)通过干扰腺苷脱氨酶来抑制核酸合成。实例包括乙嘧酚磺酸酯、甲菌定和乙嘧酚。

[0090] “苯胺嘧啶杀真菌剂(b9)”(FRAC 编码 9)旨在抑制氨基酸甲硫氨酸的生物合成，并且旨在阻断传染期间使植物细胞分解的水解酶的分泌。实例包括嘧菌环胺、灭派林和嘧霉胺。

[0091] “N- 苯基氨基甲酸酯杀真菌剂(b10)”(FRAC 编码 10)通过与 β - 微管蛋白结合并且扰乱微管组装来抑制有丝分裂。抑制微管组装可扰乱细胞分裂、在细胞和细胞结构内的传输。实例包括乙霉威。

[0092] “醌外部抑制剂(QoI)杀真菌剂(b11)”(FRAC 编码 11)通过影响泛醇氧化酶来抑制真菌内的复合物 III 线粒体的呼吸。泛醇的氧化在位于真菌线粒体内膜中的细胞色素

bc_1 复合物的“醌外部”(Q_o)位点处被阻断。抑制线粒体呼吸可阻止真菌正常生长和发展。醌外部抑制剂杀真菌剂包括甲氧基丙烯酸酯、甲氧基氨基甲酸酯、肟基乙酸酯、肟基乙酰胺和二氢二噁嗪杀真菌剂(共同地也已知为甲氧基丙烯酸酯杀真菌剂)以及噁唑烷二酮、咪唑啉酮和苄基氨基甲酸酯杀真菌剂。甲氧基丙烯酸酯类包括嘧菌酯、烯肟菌酯(SYP-Z071)和啶氧菌酯。甲氧基氨基甲酸酯包括唑菌胺酯和唑胺菌酯。肟基乙酸酯包括克收欣、唑菌酯和肟菌酯。肟基乙酰胺类包括醚菌胺、苯氧菌胺、肟醚菌胺和 α-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-2-[[[1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基]亚氨基]甲基]苯乙酰胺。二氢二噁嗪类包括氟嘧菌酯。噁唑烷二酮类包括噁唑菌酮。咪唑啉酮类包括咪唑菌酮。苄基氨基甲酸酯类包括吡菌苯威(pyribencarb)。

[0093] “苯基吡咯杀真菌剂(b12)”(FRAC 编码 12)抑制真菌内与渗透信号转导相关的 MAP 蛋白质激酶。拌种咯和咯菌腈是此杀真菌剂的实例。

[0094] “喹啉杀真菌剂(b13)”(FRAC 编码 13)旨在通过影响早期细胞信号 G-蛋白来抑制信号转导。已显示,它们可干扰引起白粉病病害的真菌产生和/或附着胞的形成。快诺芬是此类杀真菌剂的实例。

[0095] “类脂过氧化抑制剂杀真菌剂(b14)”(FRAC 编码 14)旨在通过影响真菌内的膜合成来抑制类脂过氧化。此类成员诸如土菌灵还可影响其它生物过程,诸如呼吸和黑素生物合成。类脂过氧化杀真菌剂包括芳烃和 1,2,4-噻二唑杀真菌剂。芳烃类包括联苯、地茂散、氯硝胺、五氯硝基苯、四氯硝基苯和甲基立枯磷。1,2,4-噻二唑类包括土菌灵。

[0096] “黑素生物合成抑制剂-还原酶(MBI-R)杀真菌剂(b15)”(FRAC 编码 16.1)抑制黑素生物合成中的萘醛缩还原步骤。黑素是某些真菌感染寄主植物所必需的。黑素生物合成抑制剂-还原酶杀真菌剂包括异苯并呋喃酮、吡咯并喹诺酮和三唑并苯并噻唑杀真菌剂。异苯并呋喃酮类包括四氯苯酞。吡咯并喹诺酮类包括咯喹酮。三唑并苯并噻唑类包括三环唑。

[0097] “黑素生物合成抑制剂-脱水酶(MBI-D)杀真菌剂(b16)”(FRAC 编码 16.2)可抑制黑素生物合成中的小柱孢酮脱水酶。黑素是某些真菌感染寄主植物所必需的。黑素生物合成抑制剂-脱水酶杀真菌剂包括环丙烷羧酰胺、羧酰胺和丙酰胺杀真菌剂。环丙烷羧酰胺类包括环丙酰菌胺。羧酰胺类包括双氯氰菌胺。丙酰胺类包括氰菌胺。

[0098] “羟基苯胺杀真菌剂(b17)”(FRAC 编码 17)抑制在甾醇制备中起作用的 C4-脱甲基酶。实例包括环酰菌胺。

[0099] “角鲨烯-环氧酶抑制剂杀真菌剂(b18)”(FRAC 编码 18)抑制麦角固醇生物合成途径中的角鲨烯-环氧酶。甾醇如麦角固醇是薄膜结构和功能所需的,使得它们是产生功能性细胞壁必须的。因此,其与这些杀真菌剂接触导致致敏真菌异常生长并且最终死亡。角鲨烯-环氧酶抑制剂杀真菌剂包括硫代氨基甲酸酯和烯丙胺杀真菌剂。硫代氨基甲酸酯类包括稗草畏。烯丙胺类包括奈替芬和特比萘芬。

[0100] “多抗霉素杀真菌剂(b19)”(FRAC 编码 19)抑制甲壳质合酶。实例包括多抗霉素。

[0101] “苯基脲杀真菌剂(b20)”(FRAC 编码 20)旨在影响细胞分株。实例包括戊菌隆。

[0102] “醌内部抑制剂(QiI)杀真菌剂(b21)”(FRAC 编码 21)通过影响泛醇还原酶来抑制真菌内的复合物 III 线粒体呼吸。泛醇的还原在位于真菌线粒体内膜中的细胞色素 bc_1 复合物的“醌内部”(Q_i)位点处被阻断。抑制线粒体呼吸可阻止真菌正常生长和发展。醌

内部抑制剂杀真菌剂包括氰基咪唑和氨磺酰三唑杀真菌剂。氰基咪唑类包括赛座灭。氨磺酰三唑类包括吲唑磺菌胺。

[0103] “苯甲酰胺杀真菌剂(b22)”(FRAC 编码 22)通过与 β - 微管蛋白结合并且扰乱微管组装来抑制有丝分裂。抑制微管组装可扰乱细胞分裂,扰乱细胞和细胞结构内的传输。实例包括草酰胺。

[0104] “烯醇吡喃糖醛酸抗生素杀真菌剂(b23)”(FRAC 编码 23)通过影响蛋白质生物合成来抑制真菌生长。实例包括杀稻瘟菌素 -S。

[0105] “己吡喃糖基抗生素杀真菌剂(b24)”(FRAC 编码 24)通过影响蛋白质生物合成来抑制真菌生长。实例包括春雷霉素。

[0106] “吡喃葡糖基抗生素 :“蛋白质合成杀真菌剂(b25)”(FRAC 编码 25)通过影响蛋白质生物合成来抑制真菌生长。实例包括链霉素。

[0107] “吡喃葡糖基抗生素 :海藻糖酶和肌酶生物合成杀真菌剂(b26)”(FRAC 编码 26)抑制肌醇生物合成途径中的海藻糖酶。实例包括井冈霉素。

[0108] “氰基乙酰胺肟杀真菌剂(b27)”(FRAC 编码 27)包括霜脲氰。

[0109] “氨基甲酸酯杀真菌剂(b28)”(FRAC 编码 28)被认为是真菌生长多作用点抑制剂。它们旨在干扰细胞膜中脂肪酸的合成,从而扰乱细胞膜渗透性。霜霉威、碘代丙炔基丁基甲氨酸酯和硫菌威是此类杀真菌剂的实例。

[0110] “氧化磷酸化解偶杀真菌剂(b29)”(FRAC 编码 29)通过解偶氧化磷酸化作用于抑制真菌呼吸。抑制呼吸可阻止真菌正常生长和发展。此类包括 2,6- 二硝基苯胺类诸如氟啶胺、嘧啶酮腙类诸如嘧菌腙、以及巴豆酸二硝基苯酯类诸如敌螨普、消螨普和乐杀螨。

[0111] “有机锡杀真菌剂(b30)”(FRAC 编码 30)抑制氧化磷酸化途径中的腺苷三磷酸腺苷(ATP)合酶。实例包括三苯基乙酸锡、三苯基氯化锡和三苯基氢氧化锡。

[0112] “羧酸杀真菌剂(b31)”(FRAC 编码 31)通过影响脱氧核糖核酸(DNA)II 型拓扑异构酶(旋转酶)来抑制真菌生长。实例包括[illegible]喹酸。

[0113] “杂芳族杀真菌剂(b32)”(FRAC 编码 32)旨在影响 DNA/ 核糖核酸(RNA)的合成。杂芳族杀真菌剂包括异[illegible]唑和异噻唑啉酮杀真菌剂。异[illegible]唑类包括恶霉灵,而异噻唑啉酮类包括辛噻酮。

[0114] “膦酸酯杀真菌剂(b33)”(FRAC 编码 33)包括亚磷酸及其各种盐,包括三乙膦酸铝。

[0115] “酞氨酸杀真菌剂(b34)”(FRAC 编码 34)包括叶枯酞。

[0116] “苯并三嗪杀真菌剂(b35)”(FRAC 编码 35)包括唑菌嗪。

[0117] “苯 - 磺酰胺杀真菌剂(b36)”(FRAC 编码 36)包括磺菌胺。

[0118] “哒嗪酮杀真菌剂(b37)”(FRAC 编码 37)包括哒菌清。

[0119] “噻吩 - 羧酰胺杀真菌剂(b38)”(FRAC 编码 38)旨在影响 ATP 的形成。实例包括硅噻菌胺。

[0120] “嘧啶酰胺杀真菌剂(b39)”(FRAC 编码 39)通过影响磷脂生物合成来抑制真菌生长,并且包括二氟林。

[0121] “羧酸酰胺(CAA)杀真菌剂(b40)”(FRAC)编码 40)旨在抑制磷脂生物合成和细胞壁沉积。这些过程的抑制作用阻止了目标真菌的生长并且致使其死亡。羧酸酰胺杀真菌

剂包括肉桂酰胺、缬胺酰胺氨基甲酸酯和扁桃酰胺杀真菌剂。肉桂酰胺类包括烯酰吗啉和氟吗啉。所述缬胺酰胺氨基甲酸酯类包括苯噻菌胺、异丙基苯噻菌胺、丙森锌和霜霉灭。扁桃酰胺包括双炔酰菌胺、N-[2-[4-[[3-（4-氯苯基）-2-丙炔-1-基]氧基]-3-甲氧基苯基]乙基]-3-甲基-2-[（甲基磺酰基)氨基]丁酰胺和N-[2-[4-[[3-（4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧基]-3-甲氧基苯基]乙基]-3-甲基-2-[（乙基磺酰基)氨基]丁酰胺。

[0122] “四环素抗生素杀真菌剂(b41)”(FRAC编码41)通过影响复合物1烟酰胺腺嘌呤二核苷酸(NADH)氧化还原酶来抑制真菌生长。实例包括氧四环素。

[0123] “硫代氨基甲酸酯杀真菌剂(b42)”(FRAC编码42)包括磺菌威。

[0124] “苯甲酰胺杀真菌剂(b43)”(FRAC编码43)通过使类血影蛋白离域来抑制真菌生长。实例包括氟啶酰菌胺杀真菌剂,诸如氟吡菌胺和氟吡菌酰胺。

[0125] “寄主植物防御诱导型杀真菌剂(b44)”(FRAC编码P)诱导寄主植物防御机制。寄主植物防御诱导型杀真菌剂包括苯并噻二唑、苯并异噻 唑和噻二唑-羧酰胺杀真菌剂。苯并噻二唑类包括阿拉酸式苯-S-甲基。苯并异噻唑类包括烯丙异噻唑。噻二唑-羧酰胺类包括噻酰菌胺和异噻菌胺。

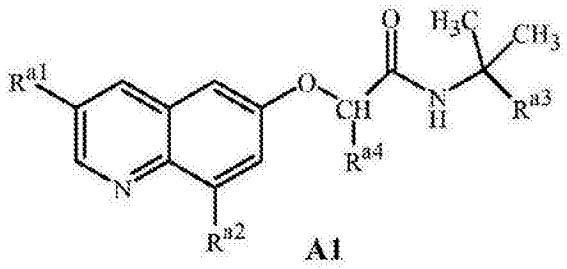
[0126] “多位点接触型杀真菌剂(b45)”通过多位点作用抑制真菌生长并且具有接触/预防活性。此类杀真菌剂包括:“铜杀真菌剂(b45.1)(FRAC编码M1)”、“硫杀真菌剂(b45.2)(FRAC编码M2)”、“二硫代氨基甲酸酯杀真菌剂(b45.3)(FRAC编码M3)”、“邻苯二甲酰亚胺杀真菌剂(b45.4)(FRAC编码M4)”、“氯腈杀真菌剂(b45.5)(FRAC编码M5)”、“硫酰胺杀真菌剂(b45.6)(FRAC编码M6)”、“胍杀真菌剂(b45.7)(FRAC编码M7)”“三嗪杀真菌剂(b45.8)(FRAC编码M8)”和“醌杀真菌剂(b45.9)(FRAC编码M9)”。“铜杀真菌剂”为无机的包含铜的化合物,通常为铜(II)氧化态;实例包括王铜、硫酸铜和氢氧化铜,包括诸如波尔多液(三元硫酸铜)的组合物。“硫杀真菌剂”为包含具有硫原子的环或链的无机化合物;实例包括元素硫。“二硫代氨基甲酸酯杀真菌剂”包含二硫代氨基甲酸酯分子部分;实例包括代森锰锌、代森联、丙森锌、福美铁、代森锰、二硫四甲秋兰姆、代森锌和福美锌。“邻苯二甲酰亚胺杀真菌剂”包含邻苯二甲酰亚胺类分子孢粉;实例包括灭菌丹、克菌丹和敌菌丹。“氯腈杀真菌剂”包含被氯和氰基取代的芳环;实例包括百菌清。“磺酰胺杀真菌剂”包括抑菌灵和对甲抑菌灵。“胍杀真菌剂”包括多果定、克热净和双胍辛胺。“三嗪杀真菌剂”包括敌菌灵。“醌杀真菌剂”包括二噻农。

[0127] “杀真菌剂,所述杀真菌剂不是组分(a)和组分(b1)至(b45)的杀真菌剂;(b46)”包括某些它的作用模式可能未知的杀真菌剂。这些包括:(b46.1)“噻唑羧酰胺杀真菌剂”(FRAC编码U5),(b46.2)“苯基乙酰胺杀真菌剂”(FRAC编码U6),(b46.3)“喹唑啉酮杀真菌剂”(FRAC编码U7),(b46.4)“二苯甲酮杀真菌剂”(FRAC编码U8)和(b46.5)“三唑并嘧啶基胺杀真菌剂”(FRAC编码45)。噻唑羧酰胺类包括噻唑菌胺。苯基乙酰胺类包括环氟菌胺和N-[[(环丙基甲氧基)氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]-亚甲基]苯乙酰胺。喹唑啉酮类包括丙氧喹啉和2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4H-1-苯并吡喃-4-酮。所述二苯甲酮包括苯菌酮和甲氧苯啶菌(pyriofenone)。所述三唑并嘧啶基胺包括苯唑 嘧菌胺,并且据信通过在泛醌-细胞色素bc1还原酶上结合未阐明的位点来抑制复合III线粒体呼吸作用。所述(b46)类还包括哒菌酮、新阿苏仁(甲基肿酸铁)、胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)、硝吡咯菌素、灭螨猛、异丁乙氧喹啉(tebufloquin)、2-[[2-氟-5-(三氟甲基)苯基]硫

代]-2-[3-(2-甲氧苯基)-2-亚噻唑烷基]乙腈、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基-3-异噁唑啉基]吡啶、N-[1-[[[1-(4-氰基苯基)乙基]磺酰基]甲基]丙基]氨基甲酸-4-氟苯酯、5-氯-6-(2,4,6-三氟苯基)-7-(4-甲基哌啶-1-基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶、N-(4-氯-2-硝基苯基)-N-乙基-4-甲基苯磺酰氨、N'-[4-[4-氯-3-(三氟甲基)苯氧基]-2,5-二甲基苯基]-N-乙基-N-甲基甲亚胺酰胺和1-[(2-丙烯硫基)羰基]-2-(1-甲基乙基)-4-(2-甲基苯基)-5-氨基-1H-吡唑-3-酮。

[0128] “杀真菌剂,所述杀真菌剂不是组分(a)和组分(b1)至(b45)的杀真菌剂;(b46)”也包括式A1的(b46.5)6-喹啉基氧基乙酰胺化合物及其盐

[0129]



A1

[0130] 其中

[0131] R^{a1}为卤素,C_1-C_4烷氧基或C_1-C_4炔基;

[0132] R^{a2}为H、卤素或C1-C_4烷基;

[0133] R^{a3}为C_1-C_{12}烷基、C_1-C_{12}卤代烷基、C_1-C_{12}烷氧基、C_2-C_{12}烷氧基烷基、C_2-C_{12}烯基、C_2-C_{12}炔基、C_4-C_{12}烷氧基烯基、C_4-C_{12}烷氧基炔基、C_1-C_{12}烷硫基或C_2-C_{12}烷硫基烷基;

[0134] R^{a4}为甲基或Y^{a1}-R^{a5};

[0135] R^{a5}为C_1-C_2烷基;并且

[0136] Y^{a1}为CH_2、O或S。

[0137] 式A1的化合物、它们作为杀真菌剂的用途以及制备的方法一般是已知的;参见例如PCT专利公布WO 2004/047538、WO 2004/108663、WO2006/058699、WO 2006/058700、WO 2008/110355、WO 2009/030469、WO2009/049716和WO 2009/087098。式A1的化合物的实例包括:2-[(3-溴-6-喹啉基)氧]-N-(1,1-二甲基-2-丁炔-1-基)-2-(甲硫基)乙酰胺、N-(1,1-二甲基-2-丁炔-1-基)-2-[(3-乙炔基-6-喹啉基)氧]-2-(甲硫基)乙酰胺、2-[(3-溴-8-甲基-6-喹啉基)氧]-N-(1,1-二甲基-2-丙炔-1-基)-2-(甲硫基)乙酰胺和2-[(3-溴-6-喹啉基)氧]-N-(1,1-二甲基乙基)丁酰胺。

[0138] “杀真菌剂,所述杀真菌剂不是组分(a)和组分(b1)至(b45)的杀真菌剂;(b46)”也包括(b46.6)N'-[4-[[3-[(4-氯苯基)甲基]-1,2,4-噻二唑-5-基]氧]-2,5-二甲基苯基]-N-乙基-N-甲基甲亚胺酰胺,其据信抑制甾醇类的生物合成涉及的C24-甲基转移酶。

[0139] 在包括下述那些的本发明的实施例中,除非在实施例中另外定义,与式1相关的包括其N-氧化物和盐,并且除非另外指明,与“式1的化合物”相关的包括发明内容中限定的取代基定义。

[0140] 实施例1:包含描述于发明内容中的组分(a)和(b)的组合物,其中在式1中,X为CHOH或NH。

[0141] 实施例 2：实施例 1 的组合物，其中 X 为 CHOH。

[0142] 实施例 3：实施例 1 的组合物，其中 X 为 NH。

[0143] 实施例 4：包含描述于发明内容或实施例 1 至 3 中任一项的组分 (a) 和 (b) 的组合物，其中在式 1 中，R^1 为卤素。

[0144] 实施例 5：实施例 4 的组合物，其中 R^1 为 F、Cl 或 Br。

[0145] 实施例 6：实施例 5 的组合物，其中 R^1 为 Cl 或 Br。

[0146] 实施例 7：包含描述于发明内容或实施例 1 至 6 中任一项的组分 (a) 和 (b) 的组合物，其中在式 1 中，R^2 为 H、氰基、F、Cl、Br 或 C_1-C_2 烷氧基。

[0147] 实施例 8：实施例 7 的组合物，其中 R^2 为 H、氰基、F、Cl、Br 或甲氧基。

[0148] 实施例 9：实施例 8 的组合物，其中 R^2 为氰基、F、Cl 或甲氧基。

[0149] 实施例 10：实施例 9 的组合物，其中 R^2 为 F 或 Cl。

[0150] 实施例 11：实施例 8 的组合物，其中 R^2 为 H。

[0151] 实施例 12：包含描述于发明内容或实施例 1 至 11 中任一项的组分(a)和(b)的组合物，其中在式 1 中，R^3 为 H 或卤素。

[0152] 实施例 13：实施例 12 的组合物，其中 R^3 为 H、F、Cl 或 Br。

[0153] 实施例 14：实施例 13 的组合物，其中 R^3 为 H、F 或 Cl。

[0154] 实施例 15：实施例 14 的组合物，其中 R^3 为 H 或 F。

[0155] 实施例 16：包含描述于发明内容或实施例 1 至 11 中任一项的组分(a)和(b)的组合物，其中在式 1 中，R^3 为卤素或甲基。

[0156] 实施例 17：实施例 16 的组合物，其中 R^3 为卤素。

[0157] 实施例 18：实施例 17 的组合物，其中 R^3 为 F、Cl 或 Br。

[0158] 实施例 19：实施例 14 或 18 的组合物，其中 R^3 为 F 或 Cl。

[0159] 实施例 20：实施例 15 或 19 的组合物，其中 R^3 为 F。

[0160] 实施例 21：包含描述于发明内容或实施例 1 至 20 中任一项的组分(a)和(b)的组合物，其中在式 1 中，R^4 为 F、Cl 或 Br。

[0161] 实施例 22：实施例 21 的组合物，其中 R^4 为 Cl 或 Br。

[0162] 实施例 23：包含描述于发明内容或实施例 1 至 22 中任一项的组分(a)和(b)的组合物，其中在式 1 中，R^5 为 H、氰基、F、Cl、Br 或 C_1-C_2 烷氧基。

[0163] 实施例 24：实施例 23 的组合物，其中 R^5 为 H、氰基、F、Cl 或甲氧基。

[0164] 实施例 25：实施例 24 的组合物，其中 R^5 为氰基、F、Cl 或甲氧基。

[0165] 实施例 26：实施例 25 的组合物，其中 R^5 为氰基或 F。

[0166] 实施例 27：实施例 26 的组合物，其中 R^5 为氰基。

[0167] 实施例 28：实施例 26 的组合物，其中 R^5 为 F。

[0168] 实施例 29：包含描述于发明内容或实施例 1 至 28 中任一项的组分(a)和(b)的组合物，其中在式 1 中，R^6 为 H、F、Cl 或 Br。

[0169] 实施例 30：实施例 29 的组合物，其中 R^6 为 H 或 F。

[0170] 实施例 31：实施例 30 的组合物，其中 R^6 为 H。

[0171] 实施例 32：包含描述于发明内容或实施例 1 至 31 中任一项的组分(a)和(b)的组合物，其中在式 1 中，最多仅 R^2 和 R^3 中的一者为 H (即，仅 R^2 和 R^3 中的一者为 H，或者 R^2 和

R^3 均不是 H)。

[0172] 实施例 33 :实施例 32 的组合物,其中 R^3 为 H (并且 R^2 不是 H)。

[0173] 实施例 34 :实施例 32 的组合物,其中 R^2 为 H (并且 R^3 不是 H)。

[0174] 实施例 35 :实施例 32 的组合物,其中 R^2 和 R^3 均不是 H。

[0175] 实施例 36 :包含描述于发明内容或实施例 1 至 35 中任一项的组分(a)和(b)的组合物,其中在式 1 中,最多仅 R^5 和 R^6 为 H(即,仅 R^5 和 R^6 中的一者为 H,或者 R^5 和 R^6 均不是 H)。

[0176] 实施例 37 :实施例 36 的组合物,其中 R^6 为 H (并且 R^5 不是 H)。

[0177] 实施例 38 :实施例 36 的组合物,其中 R^5 为 H (并且 R^6 不是 H)。

[0178] 实施例 39 :实施例 36 的组合物,其中 R^5 和 R^6 均不是 H。

[0179] 实施例 40 :包含描述于发明内容或实施例 1 至 39 中任一项的组分(a)和(b)的组合物,其中在式 1 中,最多仅 R^2、R^3、R^4 和 R^6 中的两者为 H。

[0180] 实施例 41 :实施例 40 的组合物,其中 R^2、R^3、R^4 和 R^6 中的两者为 H。

[0181] 实施例 42 :实施例 40 的组合物,其中最多仅 R^2、R^3、R^4 和 R^6 中的一者为 H。

[0182] 实施例 43 :实施例 42 的组合物,其中 R^2、R^3、R^4 和 R^6 中的一者为 H。

[0183] 实施例 44 :包含描述于发明内容或实施例 1 至 43 中任一项的组分(a)和(b)的组合物,其中组分(a)不包含式 1 化合物的 N- 氧化物。

[0184] 实施例 45 :包含描述于发明内容或实施例 1 至 44 中任一项的组分(a)和(b)的组合物,其中组分(a)包含选自以下的化合物 :

[0185] N,4- 双(2- 氯 -4- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺(化合物 47),

[0186] N-(2- 溴 -4,6- 二氟苯基)-4-(2,4- 二氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺(化合物 143),

[0187] N-(2- 溴 -4,6- 二氟苯基)-4-(2- 溴 -4- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺(化合物 195),

[0188] N-(2- 溴 -4,6- 二氟苯基)-4-(2- 氯 -4- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺(化合物 144),

[0189] 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(化合物 81),

[0190] 4-[5-[(4- 氯 -2- 氟苯基)氨基]-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -4- 基]-3,5- 二氟苯基甲腈(化合物 40),

[0191] N-(2- 氯 -4,6- 二氟苯基)-4-(2- 氯 -4- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺(化合物 82),

[0192] 4-[5-[(2- 氯 -4,6- 二氟苯基)氨基]-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -4- 基]-3- 氟苯基甲腈(化合物 238),

[0193] 4-[[4-(2- 氯 -4- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 基]氧]-3,5- 二氟苯基甲腈(化合物 13),

[0194] 4-(2- 氯 -4- 氟苯基)-N-(2,4- 二氯 -6- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺(化合物 136),

[0195] 4-(2- 氯 -4- 氟苯基)-N-(2,6- 二氟 -4- 甲氧苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺

(化合物 3)，

[0196] 4-(2-氯-4-氟苯基)-α-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-甲醇(化合物 122)，

[0197] N-(2,4-二氯-6-氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 161)，

[0198] 4-(2,4-二氯苯基)-N-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 17)，

[0199] 4-(2,6-二氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-N-(2,4,6-三氟苯基)-1H-吡唑-5-胺(化合物 7)，

[0200] 4-[[1,3-二甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)-1H-吡唑-5-基]氧]-3,5-二氟苯甲腈(化合物 8)，

[0201] 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 239)，

[0202] 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5 胺(化合物 240)，

[0203] N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 241)，

[0204] 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 244)，

[0205] N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 245)，

[0206] N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 247)，

[0207] 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氟-6-甲基苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 252)，

[0208] 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-甲基苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 253)，

[0209] N-(2-溴-6-甲基苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 254)，

[0210] N-(2-氯-6-甲基苯基)-4-(2-氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 257)，

[0211] N-(2-溴-6-甲基苯基)-4-(2-氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 258)，

[0212] 4-(2-氟-4-甲氧苯基)-N-(2-氟-6-甲基苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 259)，

[0213] N-(2-氯-6-氟苯基)-4-(2-氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 260)，

[0214] N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 261)，

[0215] 4-(2-氯-4-甲氧苯基)-N-(2-氯-6-甲基苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 262),

[0216] N-(2-溴-6-甲基苯基)-4-(2-氯-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 263),

[0217] N-(2-溴-6-甲基苯基)-4-(2-氯-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 264),

[0218] N-(2-溴-6-甲基苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 265),

[0219] 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴-6-甲基苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 266),

[0220] 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氟-6-甲基苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 267),

[0221] 4-(2,4-二氟苯基)-N-(2-氟-6-甲基苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 268),

[0222] N-(2-氯-6-甲基苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 269),

[0223] 4-(2,4-二氟苯基)-N-(2,6-二甲基苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 270),

[0224] 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2,6-二甲基苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 271),

[0225] N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 273),

[0226] N-(2-氯-6-氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 275)和

[0227] 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-甲基苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 276)。

[0228] (在这个意义上,化合物组在母体实施例的范围之内)。

[0229] 实施例 46:实施例 45 的组合物,其中组分(a)包含选自以下的化合物:化合物 3、7、8、13、17、40、47、81、82、122、136、143、144、161、195、238、239、240 和 241。

[0230] 实施例 47:实施例 46 的组合物,其中组分(a)包含选自以下的化合物:化合物 3、7、8、13、17、40、47、81、82、122、136、143、144、161、195 和 238。

[0231] 实施例 48:实施例 45 的组合物,其中组分(a)包含选自以下的化合物:化合物 239、240、241、244、245、247、252、253、254、257、258、259、260、261、262、263、264、265、266、267、268、269、270、271、273、275 和 276。

[0232] 实施例 49:实施例 48 的组合物,其中组分(a)包含选自以下的化合物:化合物 239、240 和 241。

[0233] 实施例 50:实施例 45 的组合物,其中组分(a)包含选自以下的化合物:化合物 195 和化合物 238。

[0234] 实施例 51:包含描述于发明内容或实施例 1 至 50 中任一项的组分(a)和(b)的组

合物，前提条件是，当组分（a）由选自以下的化合物组成时：

[0235] 4-（2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-N-（2,4,6-三氟苯基)-1H-吡唑-5-胺(化合物 4)、

[0236] 4-(2,6-二氟-4-甲氧苯基)-N-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 6)、

[0237] 4-(2,6-二氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-N-(2,4,6-三氟苯基)-1H-吡唑-5-胺(化合物 7)、

[0238] 4-（2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-N-（2,4,6-三氟苯基)-1H-吡唑-5-胺(化合物 11)、

[0239] 4-[[4-（2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基]氧]-3,5-二氟苯甲腈(化合物 13)、

[0240] 4-[[4-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基]氧]-3-氟苯甲腈(化合物 130)、

[0241] 4-（2-氯-4-氟苯基)-N-（2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 46)、

[0242] 4-[[4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基]氧]-3-氟苯甲腈(化合物 33)、

[0243] 3-氯-4-[[4-（2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基]氧]苯甲腈(化合物 127)、

[0244] 4-（2-氯-4-氟苯基)-α-（2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-甲醇(化合物 122)、

[0245] N,4-双(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 47)、

[0246] N-（2-氯-4-氟苯基)-4-（2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 58)、

[0247] N-（2-氯-4,6-二氟苯基)-4-（2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 86)、

[0248] N-（2-氯-4,6-二氟苯基)-4-（2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 117)、

[0249] N-（4-氯-2,6-二氟苯基)-4-（2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 121)、

[0250] N-（4-氯-2,6-二氟苯基)-4-（2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 126)、

[0251] 3-氯-4-[[4-（2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基]氧]苯甲腈(化合物 37)、

[0252] 4-[[4-（2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基]氨基]-3,5-二氟苯甲腈(化合物 25)、

[0253] N-(2-氯-4-氟苯基)-4-(2,6-二氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 23)、

[0254] α,4-双(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-甲醇(化合物 123)、

[0255] 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(化合物81)、

[0256] N-(2-氯-4,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物82)、

[0257] N-(2,6-二氯-4-氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物137)、

[0258] 3-氯-4-[5-[(2-氯-4,6-二氟苯基)氨基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-基]苯甲腈(化合物108)、

[0259] 3-氯-4-[5-[(4-氯-2,6-二氟苯基)氨基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-基]苯甲腈(化合物111)、

[0260] N-(2-溴-4-氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物118)、

[0261] 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2,4-二氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物136)、

[0262] 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2,6-二氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物138)、

[0263] 4-[[4-(2-溴-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基]氧]-3-氟苯甲腈(化合物79)、

[0264] N-(2-溴-4-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物73)、

[0265] 4-(2-溴-4-氟苯基)-1,3-二甲基-N-(2,4,6-三氟苯基)-1H-吡唑-5-胺(化合物74)、

[0266] N-(4-溴-2,6-二氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物133)、

[0267] 4-[[4-(2-溴-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基]氧]-3,5-二氟苯甲腈(化合物65)、

[0268] 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-4,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物84)、

[0269] 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(4-氯-2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物129)、

[0270] N-(4-溴-2,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物134)、

[0271] 3-溴-4-[[4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基]氧]苯甲腈(化合物139)、

[0272] 3-氯-4-[[4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基]氧]苯甲腈(化合物140)、

[0273] N-(2,4-二氯-6-氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物141)、

[0274] N-(2,6-二氯-4-氟苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺

(化合物 142)、

[0275] N-(2-溴-4,6-二氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 143)、

[0276] N-(2-溴-4,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 144)、

[0277] N-(4-溴-2,6-二氟苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 145)、

[0278] N-(2-溴-4,6-二氟苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 146)、

[0279] N-(2-溴-4,6-二氟苯基)-4-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物 147)、

[0280] α-(4-氯-2,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-甲醇(化合物 148)、

[0281] 4-[5-[(2-氯-4,6-二氟苯基)氨基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-基]-3-氟苯甲腈(化合物 238)、

[0282] 4-[5-[(4-氯-2,6-二氟苯基)氨基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-基]-3-氟苯甲腈(化合物 150)、

[0283] α-(2-氯-4,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-甲醇(化合物 151)、

[0284] α-(2-溴-4-氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-甲醇(化合物 152)、和

[0285] α-(2-溴-4-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-甲醇(化合物 153)、

[0286] 则组分(b)包含至少两种杀真菌化合物,并且

[0287] (1)当组分(b)由两种杀真菌化合物的二元组合组成,其中杀真菌化合物中的一者为环丙唑醇、恶醚唑、氟环唑、叶菌唑、腈菌唑、丙硫菌唑或戊唑醇时,则另一种杀真菌化合物 不是嘧菌酯、广谱杀菌剂、啶酰菌胺、环氟菌胺、氟吡菌酰胺、萘吡菌胺(isopyrazam)、克收欣、苯菌酮、吡噻菌胺、啶氧菌酯、丙氧喹啉、唑菌胺酯、快诺芬、环丙吡菌胺(sedaxane)或肟菌酯,并且

[0288] (2)当组分(b)由三种杀真菌化合物的三元组合组成,其中杀真菌化合物中的一种为环丙唑醇、恶醚唑、氟环唑、叶菌唑、腈菌唑、丙硫菌唑或戊唑醇,并且杀真菌化合物的另一种为啶氧菌酯或肟菌酯时,则第三杀真菌化合物不是丙氧喹啉。

[0289] 本发明的实施例,包括上文实施例 1-51 以及本文所述的任何其它实施例,它们可以任何方式组合,并且在实施例中变型的描述不仅适合包含具有至少一种其它杀真菌化合物的式 1 化合物的组合物,而且适合包含具有至少一种无脊椎害虫控制化合物或试剂的式 1 化合物的组合物,并且还适合式 1 的化合物以及它们的组合物,并且还适用于制备式 1 化合物的起始化合物和中间体化合物。此外,本发明的实施例包括适用于本发明的方法的上述实施例 1-51 和本文所述的任何其它实施例以及它们的任何组合。因此值得注意的是,另一个实施例为上文所公开的组合物,所述组合物包含(a)至少一种化合物,所述化合物选自

上文所述的式1的化合物、其N-氧化物及其盐；和至少一种无脊椎害虫控制化合物或试剂，前提条件是，当组分(a)由选自实施例51中所列的组的化合物组成时，则所述组合物包含至少两种无脊椎害虫控制化合物或试剂，或至少一种附加的杀真菌化合物(即除式1化合物以外的杀真菌化合物)。

[0290] 实施例1-51的组合可由以下示出：

[0291] 实施例A1：包含描述于发明内容的组分(a)和(b)的组合物，其中组分(a)包含式1的化合物或其盐，其中在式1中，

[0292] 最多仅R^2和R^3中的一者为H；并且

[0293] 最多仅R^5和R^6中的一者为H；

[0294] 实施例A2：实施例A1的化合物，其中在式1中，

[0295] R^1为F、Cl或Br；

[0296] R^2为H、氰基、F、Cl、Br或甲氧基；

[0297] R^3为H、F或Cl；

[0298] R^4为F、Cl或Br；

[0299] R^5为H、氰基、F、Cl或甲氧基；并且

[0300] R^6为H或F。

[0301] 实施例A3：实施例A2的化合物，其中在式1中，

[0302] R^3为H或F；并且

[0303] R^5为氰基、F、Cl或甲氧基。

[0304] 实施例A4：实施例A3的组合物，其中组分(a)包含选自以下的化合物：化合物3、化合物7、化合物8、化合物13、化合物17、化合物40、化合物47、化合物81、化合物82、化合物122、化合物136、化合物143、化合物144、化合物161、化合物195、化合物238、化合物239、化合物240和化合物241。

[0305] 实施例A5：实施例A4的组合物，其中组分(a)包含选自以下的化合物：化合物3、化合物7、化合物8、化合物13、化合物17、化合物40、化合物47、化合物81、化合物82、化合物122、化合物136、化合物143、化合物144、化合物161、化合物195和化合物238。

[0306] 实施例A6：包含描述于发明内容中的组分(a)和(b)的组合物，

[0307] 其中组分(a)包含式1的化合物或其盐，其中在式1中，

[0308] X为NH；

[0309] R^1为卤素或甲基；

[0310] R^2为H；

[0311] R^3为卤素或甲基；

[0312] R^4为卤素；

[0313] R^5为H、氰基、卤素或C_1-C_2烷氧基；并且

[0314] R^6为H或卤素；

[0315] 前提条件是，当R^1为F时，则R^3为Cl，并且当R^1为Cl时，则R^3为F。

[0316] 实施例A7：实施例A6的化合物，其中在式1中，

[0317] R^3为F或Cl。

[0318] 实施例A8：实施例A7的化合物，其中在式1中，

[0319] R^1 为 Cl 或 Br ;并且

[0320] R^3 为 F。

[0321] 实施例 A9 :实施例 A6 至 A8 中任一项所述的组合物,其中在式 1 中,最多仅 R^5 和 R^6 中的一者为 H。

[0322] 实施例 A10 :实施例 A9 的化合物,其中在式 1 中,

[0323] R^4 为 F、Cl 或 Br ;

[0324] R^5 为 H、氰基、F、Cl 或甲氧基 ;并且

[0325] R^6 为 H 或 F。

[0326] 实施例 A11 :实施例 A10 的化合物,其中在式 1 中,

[0327] R^5 为氰基、F、Cl 或甲氧基。

[0328] 实施例 A12 :实施例 A6 的组合物,其中组分(a)包含选自以下的化合物 :化合物 239、化合物 240 和化合物 241。

[0329] 实施例 B1 :发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物),其中组分(b)包含至少一种化合物,所述化合物选自(b1)苯并咪唑氨基甲酸甲酯杀真菌剂,如苯菌灵、多菌灵和甲基硫菌灵。

[0330] 实施例 B2 :发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物),其中组分(b)包含至少一种化合物,所述化合物选自(b2)二甲酰亚胺杀真菌剂,如腐霉利、异菌脲和乙烯菌核利。

[0331] 实施例 B3 :发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物),其中组分(b)包含至少一种化合物,所述化合物选自(b3)脱甲基抑制剂杀真菌剂,如氟环唑、氟喹唑、三唑醇、硅氟唑、种菌唑、嗪氨灵、环丙唑醇、恶醚唑、氟硅唑、粉唑醇、叶菌唑、腈菌唑、咪鲜安、丙环唑、丙硫菌唑、戊唑醇和氟醚唑。

[0332] 实施例 B4 :发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物),其中组分(b)包含至少一种化合物,所述化合物选自(b4)苯基酰胺杀真菌剂,如甲霜 灵、甲霜灵、甲霜灵 -M、苯霜灵、苯霜灵 -M、呋霜灵、呋酰胺和恶霜灵。

[0333] 实施例 B5 :发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物),其中组分(b)包含至少一种化合物,所述化合物选自(b5)胺 / 吗啉杀真菌剂,如杀螟丹、十二环吗啉、丁苯吗啉、克啉菌、垂吗酰胺、苯锈啶、粉病灵和螺环菌胺。

[0334] 实施例 B6 :发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物),其中组分(b)包含至少一种化合物,所述化合物选自(b6)磷脂生物合成抑制剂杀真菌剂,如敌瘟磷和稻瘟灵。

[0335] 实施例 B7 :发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物),其中组分(b)包含至少一种化合物,所述化合物选自(b7)羧酰胺杀真菌剂,如广谱杀菌剂、啶酰菌胺、萎锈灵、萘吡菌胺(isopyrazam)、氧化萎锈

[0336] 灵、戊苯吡菌胺(penflufen)和吡噻菌胺。

[0337] 实施例 B8 :发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物),其中组分(b)包含至少一种化合物,所述化合物选自(b8)羟基(2- 氨基 -)嘧啶杀真菌剂,如乙嘧酚。

[0338] 实施例 B9 :发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中

任一项的组合物)，其中组分(b)包含至少一种化合物，所述化合物选自(b9)苯胺嘧啶杀真菌剂，如嘧菌环胺。

[0339] 实施例B10：发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例1至51和A1至A12中任一项的组合物)，其中组分(b)包含至少一种化合物，所述化合物选自(b10)N-苯基氨基甲酸酯杀真菌剂，如乙霉威。

[0340] 实施例B11：发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例1至51和A1至A12中任一项的组合物)，其中组分(b)包含至少一 种化合物，所述化合物选自(b11)醌外部抑制剂杀真菌剂，如嘧菌酯、唑菌胺酯、唑胺菌酯、克收欣、肟菌酯、啶氧菌酯、唑菌酯、吡菌苯威(pyribencarb)、[illegible]唑菌酮、咪唑菌酮、discostrobin、烯肟菌酯、醚菌胺、苯氧菌胺、肟醚菌胺和氟嘧菌酯。

[0341] 实施例B12：发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例1至51和A1至A12中任一项的组合物)，其中组分(b)包含至少一种化合物，所述化合物选自(b12)苯基吡咯杀真菌剂化合物，如拌种咯和咯菌腈。

[0342] 实施例B13：发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例1至51和A1至A12中任一项的组合物)，其中组分(b)包含至少一种化合物，所述化合物选自(b13)喹啉杀真菌剂，如快诺芬。

[0343] 实施例B14：发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例1至51和A1至A12中任一项的组合物)，其中组分(b)包含至少一种化合物，所述化合物选自(b14)类脂过氧化抑制剂杀真菌剂，如地茂散。

[0344] 实施例B15：发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例1至51和A1至A12中任一项的组合物)，其中组分(b)包含至少一种化合物，所述化合物选自(b15)黑素生物合成抑制剂-还原酶杀真菌剂，如咯喹酮和三环唑。

[0345] 实施例B16：发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例1至51和A1至A12中任一项的组合物)，其中组分(b)包含至少一种化合物，所述化合物选自(b16)黑素生物合成抑制剂-脱水酶杀真菌剂，如环丙酰菌胺。

[0346] 实施例B17：发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例1至51和A1至A12中任一项的组合物)，其中组分(b)包含至少一种化合物，所述化合物选自(b17)羟基苯胺杀真菌剂，如环酰菌胺。

[0347] 实施例B18：发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例1至51和A1至A12中任一项的组合物)，其中组分(b)包含至少一 种化合物，所述化合物选自(b18)角鲨烯-环氧酶抑制剂杀真菌剂，如稗草畏。

[0348] 实施例B19：发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例1至51和A1至A12中任一项的组合物)，其中组分(b)包含至少一种化合物，所述化合物选自(b19)多抗霉素杀真菌剂，如多抗霉素。

[0349] 实施例B20：发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例1至51和A1至A12中任一项的组合物)，其中组分(b)包含至少一种化合物，所述化合物选自(b20)苯基脲杀真菌剂，如戊菌隆。

[0350] 实施例B21：发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例1至51和A1至A12中任一项的组合物)，其中组分(b)包含至少一种化合物，所述化合物选自(b21)醌内部抑制

剂杀真菌剂，如赛座灭和吲唑磺菌胺。

[0351] 实施例 B22：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分（b）包含至少一种化合物，所述化合物选自（b22）苯甲酰胺杀真菌剂，如草酰胺。

[0352] 实施例 B23：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分（b）包含至少一种化合物，所述化合物选自（b23）烯醇吡喃糖醛酸抗生素杀真菌剂，如杀稻瘟菌素 -S。

[0353] 实施例 B24：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分（b）包含至少一种化合物，所述化合物选自（b24）己吡喃糖基抗生素杀真菌剂，如春雷霉素。

[0354] 实施例 B25：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分（b）包含至少一种化合物，所述化合物选自（b25）吡喃葡糖基抗生素：蛋白质合成杀真菌剂，如链霉素。

[0355] 实施例 B26：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分（b）包含至少一种化合物，所述化合物选自（b26）吡喃葡糖基抗生素：海藻糖酶和肌醇生物合成杀真菌剂，如井冈霉素。

[0356] 实施例 B27：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至中任一项的组合物），其中组分（b）包含至少一种化合物，所述化合物选自 A12（b27）氰基乙酰胺肟杀真菌剂，如霜脲氰。

[0357] 实施例 B28：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分（b）包含至少一种化合物，所述化合物选自（b28）氨基甲酸酯杀真菌剂，如霜霉威、硫菌威和碘代丙炔基丁基甲氨酸酯。

[0358] 实施例 B29：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分（b）包含至少一种化合物，所述化合物选自（b29）氧化磷酸化解偶杀真菌剂，如氟啶胺、乐杀螨、嘧菌腙、消螨普和敌螨普。

[0359] 实施例 B30：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分（b）包含至少一种化合物，所述化合物选自（b30）有机锡杀真菌剂，如三苯基乙酸锡。

[0360] 实施例 B31：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分（b）包含至少一种化合物，所述化合物选自（b31）羧酸杀真菌剂，如[illegible]喹酸。

[0361] 实施例 B32：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分（b）包含至少一种化合物，所述化合物选自（b32）杂芳族杀真菌剂，如恶霉灵。

[0362] 实施例 B33：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至中任一项的组合物），其中组分（b）包含至少一种化合物，所述化合物选自 A12(b33) 膦酸酯杀真菌剂，如亚磷酸及其各种盐，包括三乙膦酸铝。

[0363] 实施例 B34：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分 (b) 包含至少一种化合物，所述化合物选自 (b34) 酞氨酸杀

真菌剂，如叶枯酞。

[0364] 实施例 B35：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分 (b) 包含至少一种化合物，所述化合物选自 (b35) 苯并三嗪杀真菌剂，如唑菌嗪。

[0365] 实施例 B36：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分 (b) 包含至少一种化合物，所述化合物选自 (b36) 苯 - 磺酰胺杀真菌剂，如磺菌胺。

[0366] 实施例 B37：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分 (b) 包含至少一种化合物，所述化合物选自 (b37) 哒嗪酮杀真菌剂，如哒菌清。

[0367] 实施例 B38：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分 (b) 包含至少一种化合物，所述化合物选自 (b38) 噻吩 - 羧酰胺杀真菌剂，如硅噻菌胺。

[0368] 实施例 B39：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分 (b) 包含至少一种化合物，所述化合物选自 (b39) 嘧啶酰胺杀真菌剂，如二氟林。

[0369] 实施例 B40：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分 (b) 包含至少一种化合物，所述化合物选自 (b40) 羧酸酰胺杀真菌剂，如烯酰吗啉、苯噻菌胺、异丙基苯噻菌胺、丙森锌、霜霉灭、双炔酰菌胺和氟吗啉。

[0370] 实施例 B41：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分（b）包含至少一种化合物，所述化合物选自（b41）四环素抗生素杀真菌剂，如氧四环素。

[0371] 实施例 B42：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分（b）包含至少一种化合物，所述化合物选自（b42）硫代氨基甲酸酯杀真菌剂，如磺菌威。

[0372] 实施例 B43：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分（b）包含至少一种化合物，所述化合物选自（b43）苯甲酰胺杀真菌剂，如氟吡菌胺和氟吡菌酰胺。

[0373] 实施例 B44：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分（b）包含至少一种化合物，所述化合物选自（b44）寄主植物防御诱导型杀真菌剂，如阿拉酸式苯 -S- 甲基。

[0374] 实施例 B45：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分（b）包含至少一种化合物，所述化合物选自（b45）多位点接触型杀真菌剂，如王铜、硫酸铜、氢氧化铜、波尔多液组合物（三元硫酸铜）、元素硫、代森锰锌、代森联、丙森锌、福美铁、代森锰、二硫四甲秋兰姆、代森锌、福美锌、灭菌丹、克菌丹、敌菌丹和百菌清。

[0375] 实施例 B46：发明内容中所述的组合物（包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物），其中组分（b）包含至少一种选自（b46）杀真菌剂的化合物，所述杀真菌剂不是组分（a）和组分（b1）至（b45）的杀真菌剂，如噻唑菌胺、环氟菌胺、丙氧喹啉、苯

菌酮、甲氧苯啶菌(pyriofenone)、辛唑嘧菌胺(ametoctradin)、哒菌酮、甲肿铁铵、胺苯吡菌酮、硝吡咯菌 素、灭螨猛、异丁乙氧喹啉(tebufloquin)、5- 氯 -6-(2,4,6- 三氟苯基)-7-(4- 甲基哌啶 -1- 基)[1,2,4] 三唑并 [1,5-a] 嘧啶(BAS600)、2- 丁氧基 -6- 碘 -3- 丙基 -4H-1- 苯并吡喃 -4- 酮、3-[5-(4- 氯苯基)-2,3- 二甲基 -3- 异▒唑啉基] 吡啶(SYP-Z048)、N-[1-[[[1-(4- 氰基苯基)乙基] 磺酰基] 甲基] 丙基] 氨基甲酸 -4- 氟苯酯(XR-539)、N-[[(环丙基甲氧基)氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3- 二氟苯基] 亚甲基] 苯乙酰胺、N'-[4-[4- 氯 -3-(三氟甲基)苯氧基]-2,5- 二甲基苯基]-N- 乙基 -N- 甲基甲亚胺酰胺、2-[[2- 氟 -5-(三氟甲基)苯基] 硫]-2-[3-(2- 甲氧苯基)-2- 亚噻唑烷基] 乙腈(OK-5203)、N-(4- 氯 -2- 硝基苯基)-N- 乙基 -4- 甲基苯磺酰胺(TF-991)和 1-[(2- 丙烯硫基)羰基]-2-(1- 甲基乙基)-4-(2- 甲基苯基)-5- 氨基 -1H- 吡唑 -3- 酮。

[0376] 实施例 B47 :发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物),其中组分(b)包含至少一种选自以下的杀真菌化合物(杀真菌剂):嘧菌酯、克收欣、肟菌酯、唑菌胺酯、唑菌酯、唑胺菌酯、啶氧菌酯、醚菌胺、苯氧菌胺 / 苯氧菌胺、多菌灵、百菌清、快诺芬、苯菌酮、甲氧苯啶菌(pyriofenone)、环氟菌胺、苯锈啶、丁苯吗啉、糠菌唑、环丙唑醇、恶醚唑、氟环唑、腈苯唑、氟硅唑、己唑醇、种菌唑、叶菌唑、腈菌唑、戊菌唑、丙环唑、丙氧喹啉、丙硫菌唑、戊唑醇、灭菌唑、▒唑菌酮、咪鲜安、吡噻菌胺和啶酰菌胺(啶酰菌胺)。

[0377] 实施例 B48 :实施例 B47 的组合物,其中组分(b)包含至少一种选自以下的化合物 :嘧菌酯、克收欣、肟菌酯、唑菌胺酯、唑胺菌酯、唑菌酯、啶氧菌酯、醚菌胺、苯氧菌胺 / 苯氧菌胺、快诺芬、苯菌酮、甲氧苯啶菌(pyriofenone)、环氟菌胺、苯锈啶、丁苯吗啉、环丙唑醇、恶醚唑、氟环唑、氟硅唑、叶菌唑、腈菌唑、丙环唑、丙氧喹啉、丙硫菌唑、戊唑醇、灭菌唑、▒唑菌酮和吡噻菌胺。

[0378] 实施例 B49 :发明内容中所述的组合物(包括但不限于实施例 1 至 51 和 A1 至 A12 中任一项的组合物),其中组分 (b) 包含至少一种杀真菌化合物,所述杀真菌化合物选自式 A1 化合物及其盐,其中式 A1 及在其上的取代基为如本文对于 (b46.5) 类的 6- 喹啉基氧基乙酰胺化合物公开的。

[0379] 实施例 B50 :实施例 B49 的组合物,其中组分 (b) 包含至少一种选自以下的杀真菌化合物 :2-[(3- 溴 -6- 喹啉基) 氧]-N-(1,1- 二甲基 -2- 丁炔 -1- 基)-2-(甲硫基) 乙酰胺、N-(1,1- 二甲基 -2- 丁炔 -1- 基)-2-[(3- 乙炔基 -6- 喹啉基) 氧]-2-(甲硫基) 乙酰胺、2-[(3- 溴 -8- 甲基 -6- 喹啉基) 氧]-N-(1,1- 二甲基 -2- 丙炔 -1- 基)-2-(甲硫基) 乙酰胺和 2-[(3- 溴 -6- 喹啉基) 氧]-N-(1,1- 二甲基乙基) 丁酰胺。

[0380] 值得注意的是,本文所述的实施例中任一项的组合物,包括实施例 1 至 51,A1 至 A12 和 B1 至 B50,其中与式 1 相关的包括其盐,但不包括其 N- 氧化物 ;因此,短语“式 1 的化合物”可被短语“式 1 的化合物或其盐”代替。在该组合物中值得注意的是,组分 (a) 包含式 1 的化合物或其盐。

[0381] 作为实施例还值得注意的是本发明的杀真菌组合物,所述组合物包含杀真菌有效量的实施例 1 至 51、A1 至 A12 和 B1 至 B50 的组合物,以及至少一种附加组分,所述附加组分选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂。

[0382] 本发明的实施例还包括用于控制由植物病原真菌引起的植物病害的方法,所述方

法包括向植物或其部分或向植物种子或秧苗施用杀真菌有效量的实施例 1 至 51、A1 至 A12 和 B1 至 B50 中任一项的组合物（例如作为包括如本文所述的制剂成分的组合物）。本发明的实施例也包括保护植物或植物种子免受由真菌病原体引起的病害的方法，所述方法包括向植物或植物种子施用杀真菌有效量的实施例 1 至 51、A1 至 A12 和 B1 至 B50 中任一项的组合物。

[0383] 本发明的一些实施例涉及控制主要折磨植物叶的植物病害或防止植物病害和 / 或向植物叶施用本发明的组合物（即，植株而不是种子）。优选的使用方法包括涉及上述优选组合物的那些；并且具有特殊效果的病害控制包括由真菌植物病原体引起的植物病害。用于本发明的杀真菌剂组合可有利于控制病害并且延缓抗性发展。

[0384] 方法实施例还包括：

[0385] 实施例 C1：保护植物免受病害的方法，所述病害选自白粉病、锈蜱和壳针孢属病害，所述方法包括向植物施用杀真菌有效量的组合物，所述组合物包含描述于发明内容或实施例 1 至 51 中任一项的组分（a）和（b）。

[0386] 实施例 C2：实施例 C1 的方法，其中病害为白粉病病害，并且组合物的组分（b）包含至少一种杀真菌化合物，所述杀真菌化合物选自（b4）脱甲基抑制剂（DMI）杀真菌剂、（b11）奎宁外部抑制剂（QoI）杀真菌剂和（b46.4）丙氧喹啉。

[0387] 实施例 C3：实施例 C2 的方法，其中病害为小麦白粉病。

[0388] 实施例 C4：实施例 C2 或 C3 的方法，其中组分（b）包含至少一种选自（b4）DMI 杀真菌剂的杀真菌化合物。

[0389] 实施例 C5：实施例 C4 的方法，其中组分（b）包含至少一种选自以下的杀真菌化合物：环丙唑醇、恶醚唑、氟环唑、腈菌唑、丙硫菌唑和氟醚唑。

[0390] 实施例 C6：实施例 C5 的方法，其中组分（b）包含至少一种选自以下的杀真菌化合物：环丙唑醇、恶醚唑和丙硫菌唑。

[0391] 实施例 C7：实施例 C2 或 C3 的方法，其中组分（b）包含至少一种选自（b11）QoI 杀真菌剂的杀真菌化合物。

[0392] 实施例 C8：实施例 C7 的方法，其中组分（b）包含至少一种选自以下的杀真菌化合物：嘧菌酯、啶氧菌酯和唑菌胺酯。

[0393] 实施例 C9：实施例 C2 或 C3 的方法，其中组分（b）包含（b46.4）丙氧喹啉。

[0394] 实施例 C10：实施例 C1 的方法，其中病害为锈蜱病害，并且组合物的组分（b）包含丁苯吗啉。

[0395] 实施例 C11：实施例 C10 的方法，其中病害为小麦叶锈蜱。

[0396] 实施例 C12：实施例 C1 的方法，其中病害为壳针孢属病害，并且组合物的组分（b）包含至少一种选自以下的杀真菌化合物：氟环唑、甲霜灵（包括甲霜灵 -M）、丙森锌和丁苯吗啉。

[0397] 实施例 C13：实施例 C12 的方法，其中病害为小麦叶疹斑。

[0398] 实施例 C14：保护植物免受壳针孢属病害的方法，所述方法包括向植物施用杀真菌有效量的实施例 B49 或 B50 的组合物。

[0399] 实施例 C15：实施例 C14 的方法，其中病害由叶枯病菌引起。

[0400] 实施例 C16：实施例 C14 或 C15 的方法，其中病害为小麦叶疹斑。

[0401] 实施例 C17 :实施例 C1 至 C16 中任一项的方法,其中组分(a)和(b)以协同的有效量(并且以相对于彼此的协同比)施用。

[0402] 值得注意的是关于控制由真菌植物病原体引起的植物病害的方法的实施例 C1 至 C17 对应的实施例,所述方法包括向植物或其部分施用杀真菌有效量的本发明的杀真菌组合物。

[0403] 如在发明内容中所提及,本发明还涉及式 1 的化合物或其 N- 氧化物或其盐。还已提及的是本发明的实施例,包括实施例 1-51,也涉及式 1 的化合物。因此,实施例 1-51 的组合还由以下示出 :

[0404] 实施例 D1 :式 1 的化合物、或其 N- 氧化物或其盐,其中

[0405] X 为 NH ;

[0406] R^1 为卤素或甲基 ;

[0407] R^2 为 H ;

[0408] R^3 为卤素或甲基 ;

[0409] R^4 为卤素 ;

[0410] R^5 为 H、氰基、卤素或 C_1-C_2 烷氧基 ;并且

[0411] R^6 为 H 或卤素 ;

[0412] 前提条件是,当 R^1 为 F 时,则 R^3 为 Cl,并且当 R^1 为 Cl 时,则 R^3 为 F。

[0413] 实施例 D2 :实施例 D1 中的化合物,其中

[0414] R^3 为 F 或 Cl。

[0415] 实施例 D3 :实施例 D2 中的化合物,其中

[0416] R^1 为 Cl 或 Br ;并且

[0417] R^3 为 F。

[0418] 实施例 D4 :实施例 D1 至 D4 中任一项的化合物,其中最多仅 R^5 和 R^6 中的一者为 H。

[0419] 实施例 D5 :实施例 D4 中的化合物,其中

[0420] R^4 为 F、Cl 或 Br ;

[0421] R^5 为 H、氰基、F、Cl 或甲氧基 ;并且

[0422] R^6 为 H 或 F。

[0423] 实施例 D6 :实施例 D5 中的化合物,其中

[0424] R^5 为氰基、F、Cl 或甲氧基。

[0425] 实施例 D7 :实施例 D1 至 D6 中任一项的化合物,其中化合物不是 N- 氧化物的形式(即,为式 1 或其盐的形式)。

[0426] 实施例 D8 :实施例 D1 的化合物,所述化合物选自 :

[0427] 4-(2- 氯 -4- 氟苯基)-N-(2- 氯 -6- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺 (化合物 239),

[0428] 4-(2- 溴 -4- 氟苯基)-N-(2- 氯 -6- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5 胺 (化合物 240) 和

[0429] N-(2- 溴 -6- 氟苯基)-4-(2- 氯 -4- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺 (化合物 241)。

[0430] 附加的实施例包括杀真菌组合物,所述组合物包含 :(1) 实施例 D1 至 D8 中任一项

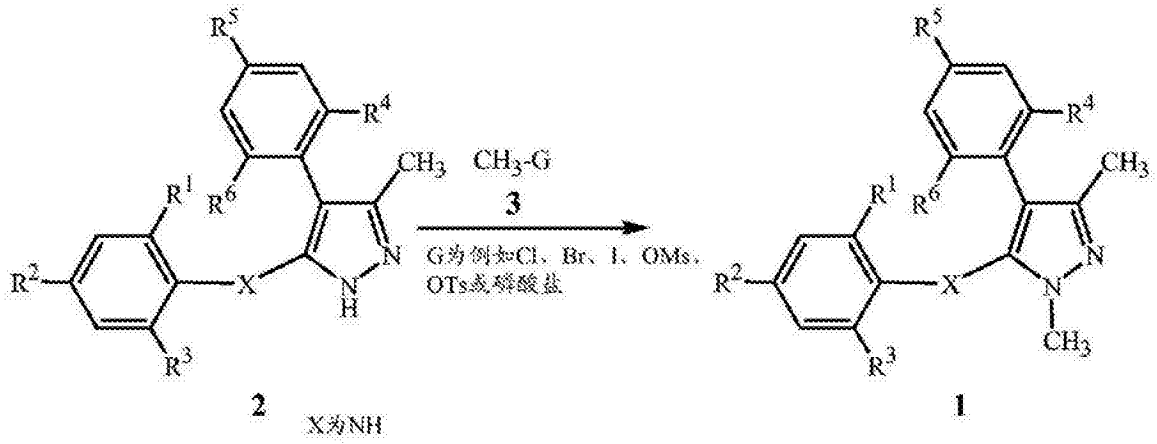
的化合物；和 (2) 至少一种附加组分，所述附加组分选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂。附加的实施例也包括保护植物或植物种子免受由真菌病原体引起的病害的方法，所述方法包括向植物（或其部分）或植物种子施用杀真菌有效量的实施例 D1 至 D8 中任一项的化合物（直接施用到植物或植物种子上，或通过环境（例如生长介质）施用）。值得注意的是用于控制由真菌植物病原体引起的植物病害的方法的实施例，所述方法包括向植物或其部分施用杀真菌有效量的实施例 D1 至 D8 中任一项的化合物。

[0431] 可使用如方案 1-17 中所述的一种或多种以下方法和变型制备式 1 的化合物。除非另外指明，在下文式 1-26 的化合物中，R^1、R^2、R^3、R^4、R^5 和 R^6 的定义如在上文发明内容中所限定。式 1a 和 1b 是式 1 的各种子集；式 4a 和 4b 是式 4 的各种子集；式 6a 和 6b 是式 6 的各种子集；式 11a 是式 11 的子集；并且式 23a 是式 23 的子集。除非另外指明，对于每个子集式的取代基如对于其母体式所定义。

[0432] 如在方案 1 中所示，其中 X 为 NH 的式 1 的化合物可通过将式 2 的 1H- 吡唑化合物与各种甲基化试剂（如式 3），如碘甲烷、磺酸甲酯（如甲磺酸甲酯 (OMs) 或甲苯磺酸甲酯 (OTs)）或磷酸三甲酯，优选在有机或无机碱，如 1,8- 二氮杂二环 [5.4.0] 十一碳 -7- 烯、碳酸钾或氢氧化钾存在的情况下，并且在诸如 N,N- 二甲基甲酰胺 (DMF)、四氢呋喃 (THF)、甲苯或水的溶剂中反应制备。

[0433] 方案 1

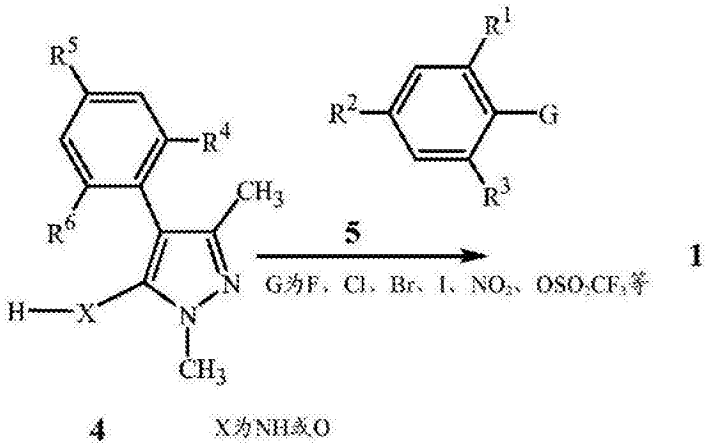
[0434]



[0435] 如在方案 2 中所示，式 1 的化合物可通过式 4 的化合物（即对于 X 为 NH 的 5- 氨基吡唑，或者对于 X 为 O 的 5- 羟基吡唑 (5- 吡唑啉酮)）和包含离去基团 G（即，卤素或（卤）烷基磺酸酯）的式 5 的芳族化合物，任选地在金属催化剂存在的情况下，并且一般在碱和诸如 N,N- 二甲基甲酰胺或二甲基亚砜的极性非质子溶剂存在的情况下的反应制备。例如，其中苯环包含吸电子取代基的式 5 的化合物通过从环上离去基团 G 的直接取代反应以提供式 1 的化合物。方案 2 的方法通过合成实例 6 的步骤 D 举例说明。式 5 的化合物可商购获得，或者它们的制备是本领域已知的。

[0436] 方案 2

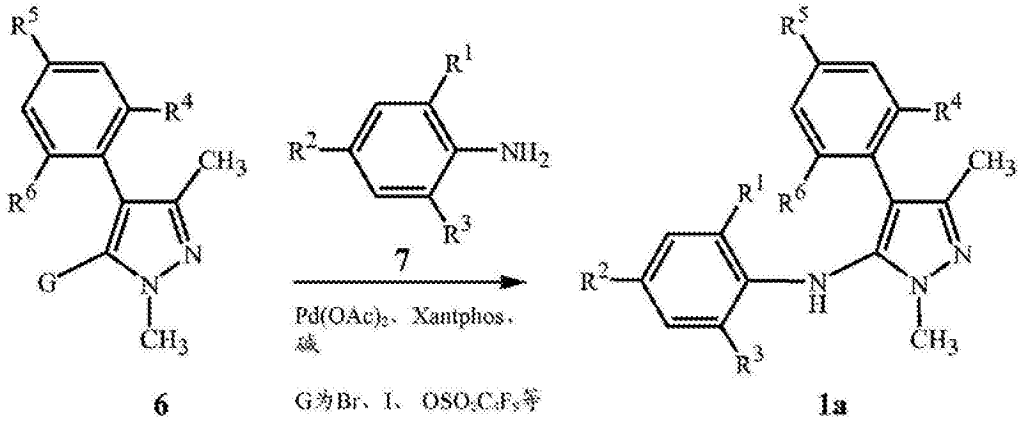
[0437]



[0438] 按照方案 2 的方法，对于其中 X 为 O 或 NH 的式 4 的化合物与其中芳族环缺乏足够的吸电子取代基的式 5 的化合物，或者为了改善反应速率、收率或产品纯度，金属催化剂(如金属或金属盐)以催化量至过量的量使用可有利于期望的反应。通常对于这些条件，G 为 Br 或 I 或磺酸盐，如 OS（O）$_2CF_3$ 或 OS（O）$_2$（CF2）$_3CF_3$。例如，可使用铜盐复合物(如 CuI 与 N,N'－二甲基乙二胺、脯氨酸或吡啶)、钯复合物(如三(二亚苄基丙酮)二钯(0))或钯盐(如乙酸钯)与诸如 4,5- 双(二苯基膦基)-9,9- 二甲基氧杂蒽(即“Xantphos”)、2- 二环己基膦基 -2',4',6'－三异丙基联苯(即“Xphos”)或 2,2'－双(二苯基膦基)-1,1'－联二萘(即“BINAP”)的配体，在诸如碳酸钾、碳酸铯、苯氧化钠或叔－丁醇钠的碱存在的情况下，在诸如 N,N- 二甲基甲酰胺、1,2- 二甲氧基乙烷、二甲基亚砜、1,4- 二氧六环或甲苯的溶剂中任选地与诸如乙醇的醇混合。作为另外一种选择，如在方案 3 中举例说明，式 1a 的化合物(即其中 X 为 NH 的式 1)可通过式 6 的化合物(即 5- 溴吡唑或其它在 5- 位上被离去基团取代的吡唑类)与式 7 的化合物在类似于上文对于方案 2 所描述的那些金属催化的条件下的反应制备。方案 3 的方法通过合成实例 1 的步骤 C 和合成实例 2 的步骤 E 举例说明。式 7 的化合物可商购获得，或者它们的制备是本领域已知的。

[0439] 方案 3

[0440]

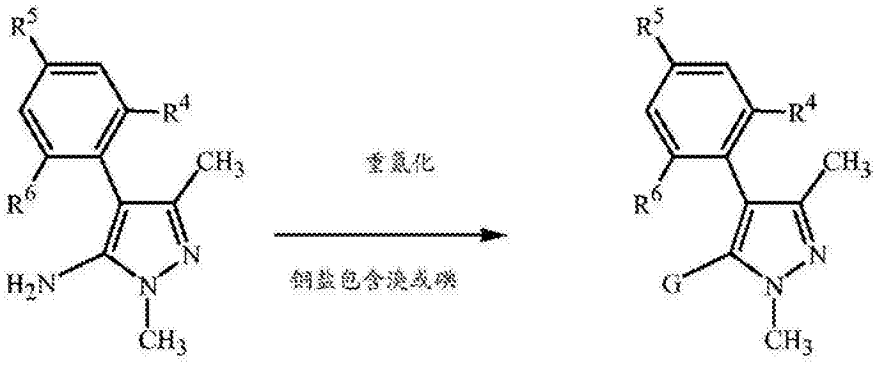


[0441] 如在方案 4 中所示，其中 G 为 Br 或 I 的式 6 的化合物，可通过式 4a 的 5- 氨基吡唑(即式 4，其中 X 为 NH)在重氮化条件下，在包含溴或碘的铜盐的存在下或随后与包含溴或碘的铜盐组合进行制备。例如，在 $CuBr_2$ 存在的情况下，在诸如乙腈的溶剂中向式 4a 的 5- 氨基吡唑溶液添加叔－丁基亚硝酸盐以提供对应的式 6 的 5- 溴吡唑。同样地，式 4a 的 5- 氨基吡唑可被转化成重氮盐并然后转变成相应的式 6 的 5- 卤吡唑，通过与亚硝酸钠在溶剂如

水、乙酸或三氟乙酸中，在通常包含相同的卤化物原子(对于 G 为 I，如 HI 水溶液)无机酸的存在下处理，随后用相应的铜(I)或铜(II)盐依照对本领域的技术人员熟知的一般方法处理。方案 4 的方法通过合成实例 1 的步骤 B 和合成实例 2 的步骤 D 举例说明。

[0442] 方案 4

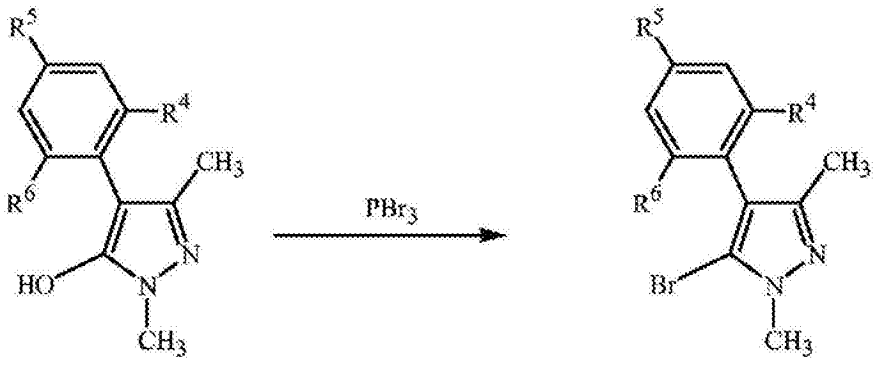
[0443]



[0444] 如方案 5 所示，式 6a 的 5- 溴吡唑(即式 6，其中 G 为 Br)可通过将式 4b 的 5- 羟基吡唑(即其中 X 为 O 的式 4)与三溴化磷，如在 Tetrahedron Lett. 2000，41 (24)，4713 中所述的反应制备。

[0445] 方案 5

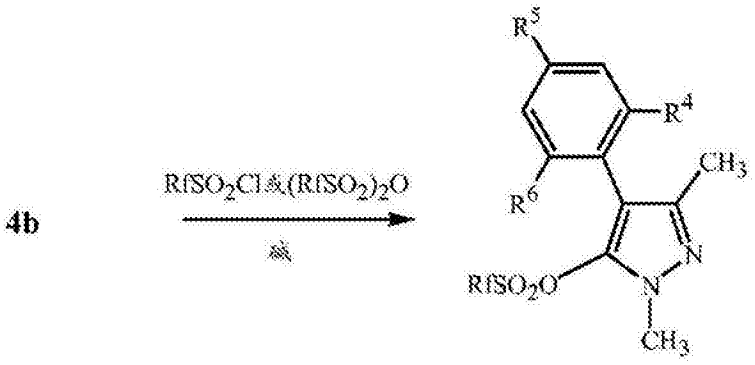
[0446]



[0447] 如方案 6 所示，式 4b 的 5- 羟基吡唑还可被用于制备式 6b 的 5- 氟烷基磺酰基(如 5- 三氟甲烷磺酰基、5- 九氟丁基磺酰基)吡唑(即式 6，其中 G 为氟烷基磺酰基)，如在 Synlett，2004 年，第 5 卷，795 页中所述。

[0448] 方案 6

[0449]



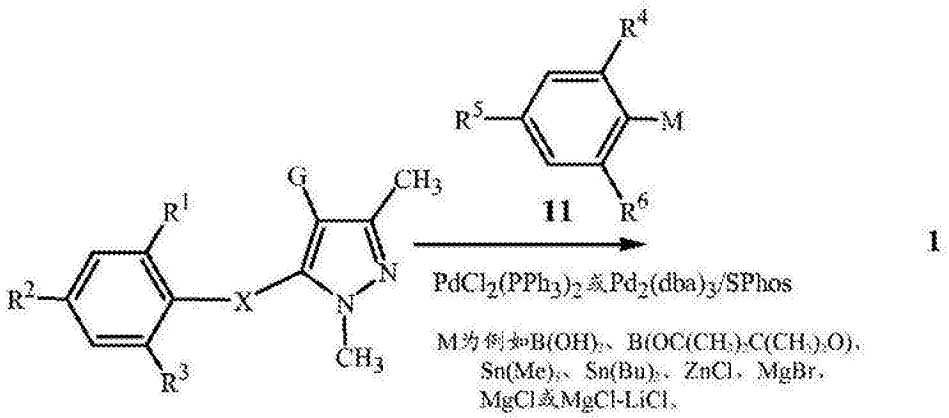
其中Rf为氟烷基如CF3或(CF2)2CF3

6b

[0450] 如方案 7 所示，式 1 的化合物可通过其中 X 为 O 或 NH 的式 10 的 4- 溴或碘代吡唑与式 11 的有机金属化合物在过渡金属催化的交叉偶联反应条件下的反应制备。式 10 的 4- 溴或碘代吡唑与硼酸、三烷基锡、锌或式 11 的有机镁试剂，在具有适当的配体（如三苯基膦（PPh_3）、二亚苄基丙酮 （dba）、二环己基（2',6'- 二甲氧基 [1,1'- 联苯]-2- 基）膦（SPhos））的钯或镍催化剂和碱（如果需要的话）存在的情况下的反应提供对应的式 1 的化合物。例如，其中 M 为 B（OH）$_2$、B（OC（CH_3）$_2$C（CH_3）$_2$O）或 B（O-*i*-Pr）$_3^{\ominus}$ $Li^{\oplus}$的取代的芳基硼酸或衍生物，如式 11 与式 10 的 4- 溴 - 或 4- 碘吡唑在双（三苯基膦）二氯化钯（II）和诸如碳酸钠或氢氧化钾的含水碱存在的情况下，在诸如 1,4- 二氧六环、1,2- 二甲氧基乙烷、甲苯或乙醇的溶剂中反应，或在无水的条件下与诸如氧化膦的配体或亚磷酸盐配体（如二苯基膦氧化物）和氟化钾在诸如 1,4- 二氧六环的溶剂中反应（参见 Angewandte Chemie，国际版 2008,47（25）,4695-4698）以提供对应的式 1 的化合物。方案 7 的方法通过本合成实例 3 的步骤 C 举例说明。

[0451] 方案 7

[0452]

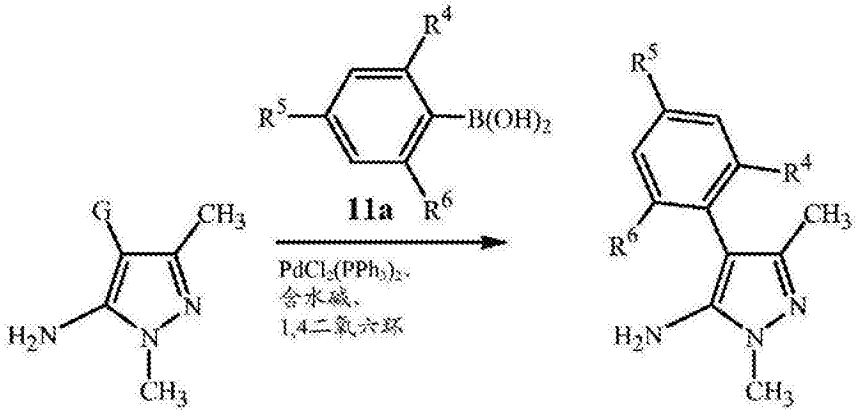


10 G为Br、I X为NH或O

[0453] 如在方案 8 中举例说明，式 4a 的化合物（即其中 X 为 NH 的式 4）可通过将式 12 的化合物与式 11a 的化合物（如式 11 化合物，其中 M 为 B（OH）$_2$）使用如对于方案 7 的方法所述的过渡金属催化交叉偶联反应条件的反应制备。

[0454] 方案 8

[0455]

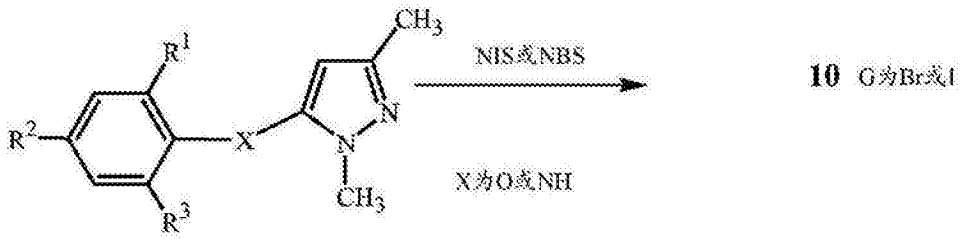


12 G为Br、I 4a

[0456] 如在方案 9 中举例说明，其中 X 为 O 或 NH 并且 G 为 Br 或 I 的式 10 的吡唑通过在 4- 位未取代的吡唑（式 13）与卤化试剂，如溴、亚溴酸钠、N- 溴琥珀酰亚胺 (NBS) 或 N- 碘琥珀酰亚胺 (NIS) 在溶剂如乙酸、乙腈、N,N- 二甲基甲酰胺、N,N- 二甲基乙酰胺或 1,4- 二氧六环或水与上述溶剂的混合物，在环境温度至溶剂沸点温度范围内的反应容易地制备。方案 9 的方法通过合成实例 3 的步骤 B 举例说明。

[0457] 方案 9

[0458]

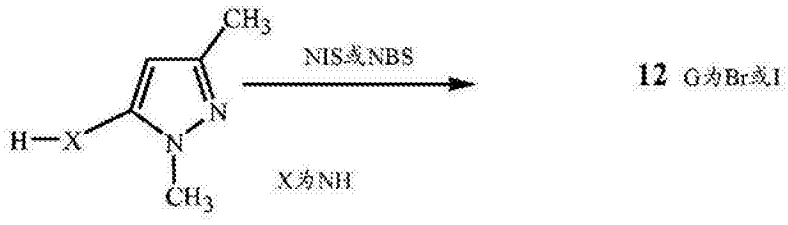


13

[0459] 如在方案 10 中举例说明，使用类似于对于方案 9 的方法的那些反应条件，其中 X 为 NH 的式 14 的吡唑可被转变成中间体 12，其可用于制备如在方案 8 中所述的式 4a 的化合物。其中 X 为 NH 的式 14 的化合物可由本领域已知的方法制备。此外，其中 X 为 NH 的式 14 的化合物可商购获得。

[0460] 方案 10

[0461]

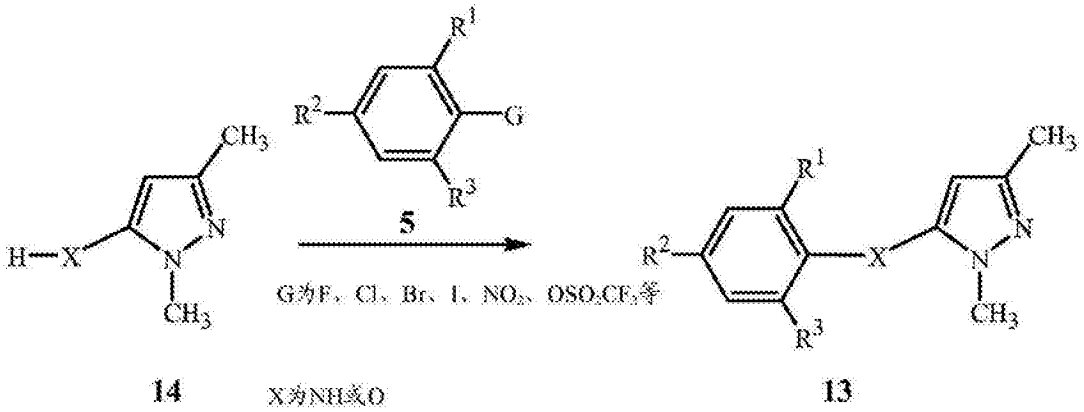


14

[0462] 如在方案 11 中所示，其中 X 为 O 或 NH 的式 13 化合物可通过类似于方案 2 的方法所用的那些步骤由对应的式 14 的化合物制备。方案 11 的方法通过合成实例 3 的步骤 A 举例说明。式 14 的化合物可商购获得或可由本领域已知的方法制备。

[0463] 方案 11

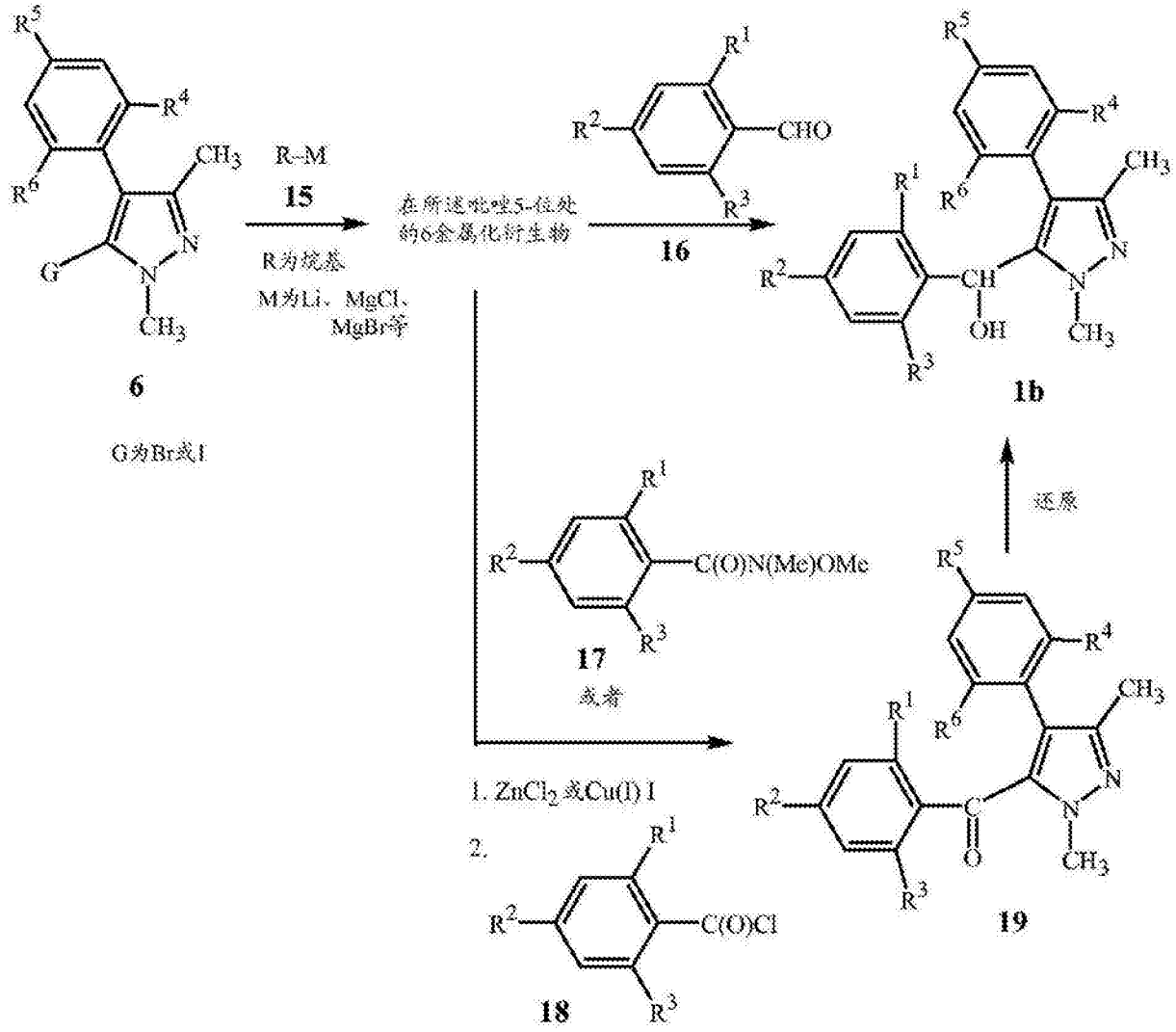
[0464]



[0465] 如在方案 12 中所示，式 1b 的化合物（即其中 X 为 CHOH 的式 1），可通过用有机金属试剂（即式 15）如烷基锂，优选正丁基锂或烷基镁试剂，优选异丙基氯化镁（任选地与氯化锂络合）处理式 6 的化合物，随后通过添加式 16 的取代的苯甲醛制备。方案 12 的该方法通过合成实例 5 举例说明。作为另外一种选择，式 1b 的化合物可通过使用本领域熟知的标准方法（如甲醇中的硼氢化钠或甲醇）还原式 19 的酮制备。式 19 的酮可通过式 6 的化合物的相同金属化吡唑衍生物与式 17 或 18 的碳亲电体反应制备。反应温度可在 -90℃至反应溶剂沸点范围内；-78℃至环境温度的温度通常是优选的，当使用烷基锂试剂时，-78至 -10℃的温度是优选的，并且由于使用烷基镁试剂，-20℃至环境温度是优选的。多种溶剂是有用的，如 甲苯、乙醚、四氢呋喃或二甲氧基甲烷；无水四氢呋喃是优选的。第二金属组分，如氯化锌、溴化锌或一价铜盐，如碘化铜 (I) 或氰化铜 (I)，可有利地在亲电体之前添加，以防其中所述亲电体为式 18 的化合物。式 16、17 和 18 的羰基中间体可商购获得或可由本领域已知的方法制备。

[0466] 方案 12

[0467]

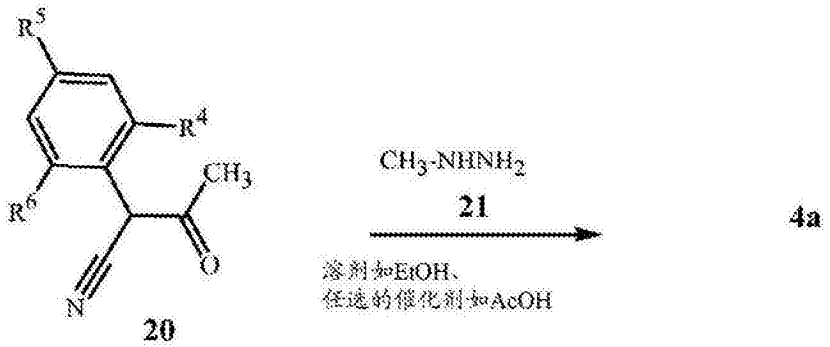


[0468] 被本领域技术人员公认的是,类似于方案12中所示的那些反应还可使用在4位上缺少取代基的吡唑,因此提供某些可用于方案9中概括的方法的式13的化合物。

[0469] 可用于制备式4a的5-氨基吡唑的通常方法在本领域是熟知的;参见例如Journal für Praktische Chemie(Leipzig)1911,83,171和J.Am Chem.Soc.1954,76,501。此类方法在方案13中举例说明。方案13的方法通过本合成实例1的步骤A和本合成实例2的步骤C举例说明。

[0470] 方案13

[0471]

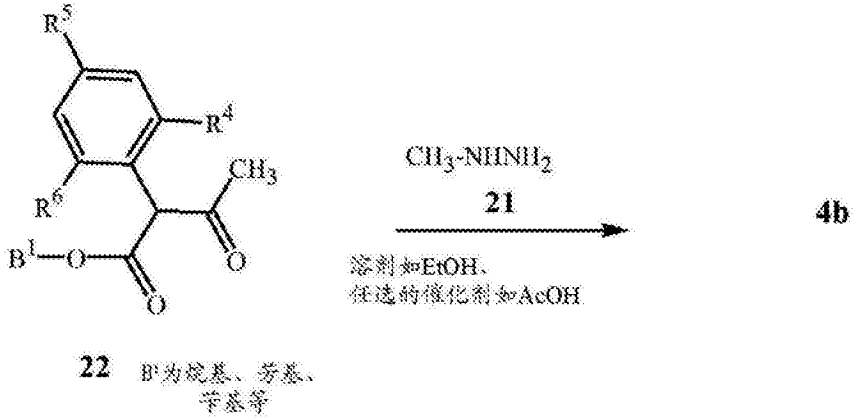


[0472] 类似地,可用于制备式4b的5-羟基吡唑的通常方法在本领域是熟知的;参见例如

Annalen der Chemie1924,436,88。此类方法在方案 14 中举例说明。方案 14 的方法通过本合成实例 6 的步骤 C 举例说明。

[0473] 方案 14

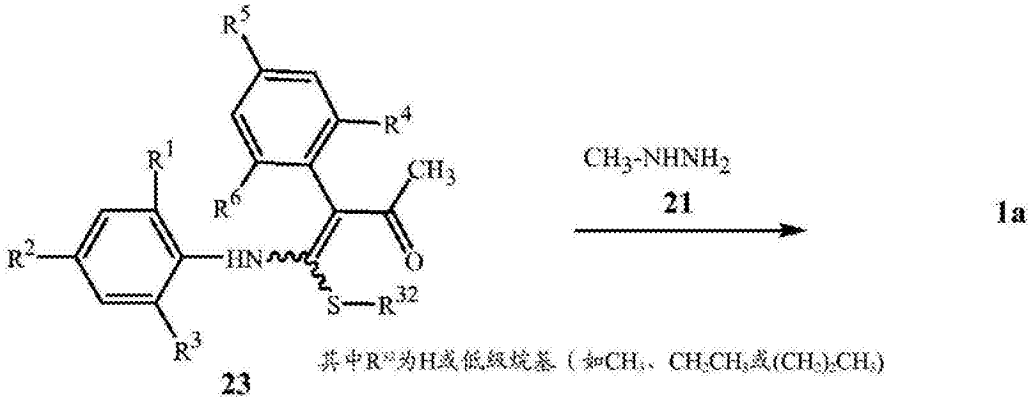
[0474]



[0475] 如方案 15 中所示，式 1a 的化合物(即其中 X 为 NH 的式 1)可依照本领域已知的一般方法将式 23 的化合物与甲基肼(式 21)在诸如乙醇或甲醇溶剂中缩合制备，并且任选地在酸或碱催化剂，如乙酸、哌啶或甲醇钠存在的情况下。方案 15 的方法通过合成实例 4 的步骤 B 和合成实例 7 的步骤 C 举例说明。

[0476] 方案 15

[0477]

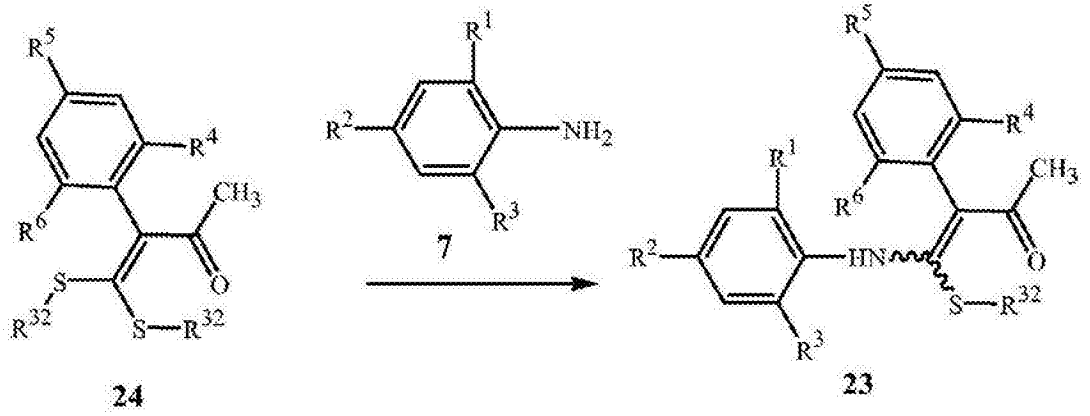


[0478] 在一定程度上类似于方案 15 的方法，其中 X 为 NH 的式 23 的化合物可通过式 2 的化合物与肼缩合类似地制备。该方法描述于 Chemistry ofHeterocyclic Compounds,2005 年，第 41 (1)卷，105-110 页。

[0479] 如方案 16 中所示，式 23 的化合物(其中 R^{32} 为 H 或低级烷基，如 CH_3、CH_2CH_3 或 $(CH_2)_2CH_3$)可通过式 24 对应的烯酮二硫缩酮化合物与式 7 的化合物，任选地在诸如氢化钠或乙基氯化镁的碱存在的情况下，在诸如甲苯、四氢呋喃或二甲氧基甲烷的溶剂中，在 -10℃至所述溶剂的沸点温度范围内的反应制备。参见例如，J.Heterocycl.Chem.1975,12 (1),139。可用于制备式 24 的化合物的方法是本领域已知的。

[0480] 方案 16

[0481]

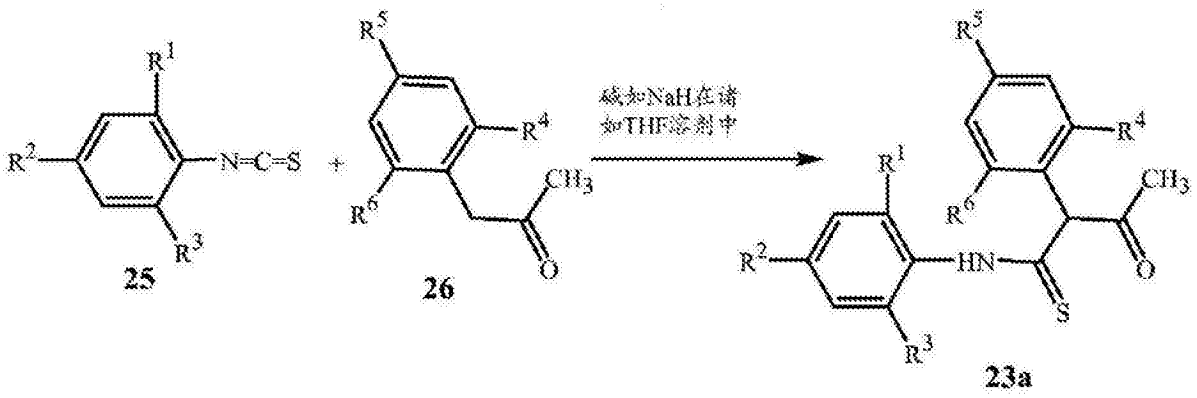


其中R^{32}为H或低级烷基（如CH_3、CH_2CH_3或$(CH_2)_3CH_3$）

[0482] 如在方案 17 中所示，式 23a 的化合物(即，式 23 的互变异构体，其中 R^{32} 为 H)可通过式 25 对应的异硫氰酸酯化合物与式 26 的芳基丙酮化合物的反应制备。参见例如 Zhurnal Organicheskoi Khimii，1982 年，第 18 (12) 卷，第 2501 页。可用于该反应的碱包括氢化钠、醇盐碱(如叔丁醇钾或乙醇钠)、氢氧化钾、氢氧化钠、碳酸钾或胺碱(如三乙胺或 N,N- 二异丙基乙胺)。可用多种溶剂，如四氢呋喃、醚、甲苯、N,N- 二甲基甲酰胺、醇(如乙醇)、酯(如乙酸乙酯或乙酸异丙酯)、或它们的混合物。选择与所选的碱相容的溶剂，如本领域所熟知的。反应温度可在 -78℃至溶剂沸点范围内。碱和溶剂的一个有用的混合物为四氢呋喃中的叔丁醇钾，在 -70 至 0℃下，向其中添加式 25 的异硫氰酸酯和式 26 的羰基化合物的溶液，它们可混合成一种溶液或分别添加，优选添加羰基化合物，随后添加异硫氰酸酯。方案 17 的方法通过合成实例 4 的步骤 A 和合成实例 7 的步骤 C 举例说明。

[0483] 方案 17

[0484]



[0485] 式 23a 的羰基硫代酰胺还可通过使相应的酮酰胺与硫化试剂，如 Lawesson 试剂或 P_2S_5 反应制备；参见例如 Helv. Chim. Act. 1998 年，第 81 (7) 卷，第 1207 页。

[0486] 本领域的技术员认识到，各种官能团可被转变成其它，以提供不同的式 1 的化合物。例如，制备式 1 的化合物的中间体可包含芳族硝基，其可被还原成氨基，然后经由本领域熟知的反应如 Sandmeyer 反应，被转换成各种卤化物，以提供式 1 的化合物。通过类似已知的反应，芳族胺(苯 胺)可经由重氮盐转变成酚，然后其可被烷基化以制备具有烷氧基取代基的式 1 的化合物。类似地，通过 Sandmeyer 反应制备的芳族卤化物，如溴化物或碘化物可在铜催化条件下与醇，如 Ullmann 反应或其已知的修改形式反应以提供包含烷氧基取代基的式 1 的化合物。此外，某些卤素基团，如氟或氯，可在碱性条件下被醇取代以提供包含

相应的烷氧基取代基的式 1 的化合物。

[0487] 上述反应还可在许多情况下以轮流顺序进行，如 1H 吡唑的制备可通过下文举例说明的关于取代的吡唑普通制备反应用于方案 2 中的反应。

[0488] 应认识到，上述用于制备式 1 的化合物的某些试剂和反应条件可能不与中间体中存在的某些官能团相容。在这些情况下，将保护 / 去保护序列或官能团互变体加入合成中将有助于获得所期望的产物。保护基团的使用和选择对化学合成领域的技术人员将显而易见(参见例如 Greene，T.W.Wuts，P.G.M.Protective Groups in Organic Synthesis，第二版 ；Wiley ：New York，1991)。本领域的技术人员将认识到，在一些情况下，在按照任何单独方案中的描述引入指定试剂后，可能需要实施未详细描述的附加常规合成步骤以完成式 1 化合物的合成。本领域的技术人员还将认识到，可能需要以与制备式 1 的化合物时所示的具体顺序不同的顺序来实施上文方案中示出的步骤的组合。本领域的技术人员还将认识到，本文所述的式 1 的化合物和中间体可经历各种亲电反应、亲核反应、自由基反应、有机金属反应、氧化反应和还原反应，以引入取代基或修饰现有的取代基。

[0489] 无需进一步详尽说明，据信本领域的技术人员使用以上所述内容可将本发明利用至最大限度。因此，以下合成实例应理解为仅是例证性的，而不以任何方式限制本发明的公开内容。以下合成实例中的步骤示出了整个合成转化中每个步骤的过程，并且用于每个步骤的原料不必由过程描述于其它实例或步骤中的具体制备步骤制得。百分比均按重量计，除非是色谱溶剂混合物或除非另外指明。除非另外指明，色谱溶剂混合物的份数和百分比均按体积计。除非另外指明，^{1}H NMR 谱由四甲基硅烷在 $CDCl_3$ 中以 ppm 的低场报道 ；“s”表示单峰、“m”表示多峰、“br s”表示宽单峰。质谱(MS)作为通过向所述分子加成 H^+ (分子量为 1)所形成的最高同位素丰度母离子(M+1)的分子量报道，采用大气压化学电离 (AP^+) 通过质谱仪观察，其中“amu”代表原子的质量单位。报道了包含一个或多个较低丰度(如 ^{37}Cl、^{81}Br)的较高原子量同位素的分子离子的存在。“LC/MS”涉及通过液相色谱法物理分离化学化合物以及通过质谱仪质量分析所分离的化合物的组合。

[0490] 合成实例 1

[0491] 制备 4-（2-氯 -4-氟苯基)-N-（2,6-二氟 -4-甲氧苯基)-1,3-二甲基 -1H-吡唑 -5-胺(化合物 3)

[0492] 步骤 A ：制备 4-[2-氯 -4-氟苯基]-1,3-二甲基 -1H-吡唑 -5-胺

[0493] 干燥的固体乙醇钠(Aldrich，10.2g，150mmol) 在二甲苯(60mL) 和无水乙醇(25mL) 的混合物中的悬浮液在 70℃下搅拌，并且经过 20 分钟，将 2-氯 -4-氟苯乙腈(16.96g，100mmol) 在乙酸乙酯(30mL) 和乙醇(5mL) 的混合物中滴加至热的反应混合物中。将所述反应混合物在 75-78℃下加热 3h，然后使其冷却。添加水(50mL) 以溶解固体。用乙酸乙酯萃取混合物一次并丢弃提取物。通过添加 1N 的含水盐酸将水相酸化至 pH2，然后用乙酸乙酯(50mL) 萃取。干燥($MgSO_4$) 乙酸乙酯相并蒸发，以提供中间体产物 α - 乙酰基 -2-氯 -4-氟苯乙腈(14.8g) 的固体。

[0494] 上文获得的产物的一部分(4.61g，21.8mmol) 在乙醇(15mL) 中搅拌，并且添加冰醋酸(3mL)和甲基肼(1.17mL，21.8mol)。搅拌该反应混合物并在回流下加热过夜。然后在减压下浓缩反应混合物，并且所得的残余物用乙酸乙酯粉碎。所得的固体被收集在玻璃料上并且在空气中干燥，以提供标题化合物(2.42g) 的白色固体。

[0495] ^{1}H NMR δ 7.2-7.3 (m,2H),7.0 (m,1H),3.7 (s,3H),3.4 (br s,2H),2.1 (s,3H)。MS:240amu (AP^+)。

[0496] 步骤 B :制备 5- 溴 -4- (2- 氯 -4- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑

[0497] 溴化铜(II)(3.94g,17.7mmol)被添加到 4-[2- 氯 -4- 氟苯基]-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺(即,步骤 A 的产物)(2.4g,10mmol)于乙腈(50mL)中的溶液中,并且所述混合物被搅拌,并且在冰水浴中冷却的同时,经过 5min 滴加叔丁基亚硝酸盐(90% 工业级,2.33mL,17.7mmol)。使所述反应混合物缓慢温热至环境温度。加入 HCl 水溶液(20mL),然后加入乙酸乙酯(20mL)。该混合物通过 2-cm 的Celite®硅藻土的助滤剂 垫块过滤。所述过滤垫块用乙酸乙酯(20mL)洗涤,并且分离所述相。所述有机相用 1.0N 的盐酸水溶液和盐水洗涤,经过 $MgSO_4$ 干燥并且浓缩,以留下标题化合物(2.8g)的棕橙色半固体。

[0498] ^{1}H NMR δ 7.18-7.25 (m,2H),7.04 (m,1H),3.89 (s,3H),2.14 (s,3H)。

[0499] 步骤 C :制备 4- (2- 氯 -4- 氟苯基)-N- (2,6- 二氟 -4- 甲氧苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺

[0500] 5- 溴 -4-(2- 氯 -4- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑,(即,步骤 B 的产物)(0.20g,0.66mmol)、乙酸钯(II)(15mg,0.066mmol)、4,5- 双(二苯基膦基)-9,9- 二甲基氧杂蒽(76mg,0.13mmol)和粉末状的碳酸钾(1.8g,13mmol)被混合在无水的 1,4- 二氧六环(3mL)中,并且所述混合物用 N_2 气流在液面下曝气 10min。一次性加入 2,6- 二氟 -4- 甲氧基苯胺(0.22g,1.3mmol),并且在回流下加热反应混合物 22h。将反应混合物通过Celite®硅藻土助滤剂过滤,并且所述过滤垫块用乙酸乙酯(20mL)洗涤。所述滤液用水(10mL)和盐水(10mL)洗涤,经过 $MgSO_4$ 干燥并浓缩,以留下半固体剩余物。该剩余物由柱层析,通过 5g 的硅胶,用梯度己烷 / 乙酸乙酯(20:1 至 1:3)洗脱纯化,以提供标题化合物(48mg)的浅棕色固体。

[0501] ^{1}H NMR δ 7.0-7.1(m,2H),6.85(m,1H),6.26(m,2H),4.84(br s,1H),3.78(s,3H),3.66 (s,3H),2.08 (s,3H)。MS:382amu (AP^+)。

[0502] 合成实例 2

[0503] 制备 4- (2,6- 二氟 -4- 甲氧苯基)-1,3- 二甲基 -N- (2,4,6- 三氟苯基)-1H- 吡唑 -5- 胺(化合物 7)

[0504] 步骤 A :制备 2,6- 二氟 -4- 甲氧基苯乙腈

[0505] 将 KCN(0.88g,13mmol)溶解于水(2mL)的溶液滴加至水浴冷却的 2,6- 二氟 -4- 甲氧基溴化苄(2.50g,10.5mmol)于 N,N- 二甲基甲酰胺(10mL)的溶液中。将所述反应混合物搅拌 20 分钟。加入水(20mL),然后将反应混合物倾倒在饱和的 $NaHCO_3$ 水溶液(20mL)中并用醚 (50mL)萃取。所述有机相用水(5×25mL)洗涤,经过 $MgSO_4$ 干燥并浓缩,以提供在放置时结晶的油,从而提供标题化合物(1.9g)的固体。

[0506] ^{1}H NMR δ 6.50 (m,2H),3.80 (s,3H),3.65 (s,2H)。

[0507] 步骤 B :制备 α - 乙酰基 -2,6- 二氟 -4- 甲氧基苯乙腈

[0508] 将固体乙醇钠(4.7g,66mmol)在二甲苯(20mL)和乙醇(10mL)的混合物中搅拌,并加热至 50℃。滴加 2,6- 二氟 -4- 甲氧基苯乙腈(即,步骤 A 的产物)(8.0g,44mmol)于乙酸乙酯(10.4mL)中的溶液。将所述反应混合物在 50℃加热 4h,然后使其冷却至室温。将所述反应混合物倾入水中(100mL)并且用乙酸乙酯(25mL)萃取。所述水相用 3N 的含水的 HCl 酸化至 pH4,并用乙酸乙酯(100mL)萃取。该有机相用水(50mL)、盐水(50mL)洗涤,然

后经过 $MgSO_4$ 干燥并浓缩，以留下标题化合物（8.0g）的棕褐色半固体。

[0509] ^1H NMR δ 6.56（m，2H），4.86（s，1H），3.83（s，3H），2.40（s，3H）。

[0510] 步骤 C：制备 4-（2，6- 二氟 -4- 甲氧苯基）-1，3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺

[0511] α - 乙酰基 -2，6- 二氟 -4- 甲氧基苯乙腈（即，步骤 B 的产物）（8.03g，35.7mmol）和乙酸（5mL）在乙醇（35mL）中搅拌，并且添加甲基肼（1.91mL，35.7mmol）。在回流下将所述反应混合物加热 16h，冷却，然后倾入水中（100mL）。用乙酸乙酯（100mL）萃取所得混合物。所述有机相用 1N 的含水 NaOH（50mL），然后为盐水（50mL）洗涤，经过 $MgSO_4$ 干燥并浓缩，以留下固体。将固体溶解于甲醇中，并且所得的溶液被加热至 45℃。滴加水（25mL）并且使混合物冷却。在玻璃料上收集所述沉淀，以提供标题化合物（3.88g）的白色固体。

[0512] ^1H NMR δ 6.55（m，2H），3.81（s，3H），3.67（s，3H），3.43（br s，2H），2.09（s，3H）。

[0513] 步骤 D：制备 5- 溴 -4-（2，6- 二氟 -4- 甲氧苯基）-1，3- 二甲基 -1H- 吡唑

[0514] 溴化铜（II）（3.81g，16.9mmol）被加入 4-（2，6- 二氟 -4- 甲氧苯基）-1，3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺（即，步骤 C 的产物）（3.88g，15.4mmol）于乙腈（50mL）的溶液中，并且搅拌所述混合物，并且在冰水浴中冷却的同时，经过 5min 滴加叔 - 丁基亚硝酸盐（90% 工业级，3.54mL， 26.9mmol）。使所述反应混合物缓慢温热至环境温度。加入盐酸的水溶液（25mL），然后加入乙酸乙酯（25mL）。并且所得混合物通过 2-cm 的 Celite® 硅藻土的助滤剂垫块过滤。所述过滤垫块用乙酸乙酯（50mL）洗涤，并且分离所述相。所述有机相用 1N 的 HCl 水溶液（25mL）和盐水（25mL）洗涤，经过 $MgSO_4$ 干燥并浓缩。所述的剩余物用柱层析，通过 24g 的硅胶，用梯度的己烷 / 乙酸乙酯（9:1 至 1:1））洗脱纯化，以提供标题化合物（3.25g）的白色固体。

[0515] ^1H NMR δ 6.54（m，2H），3.88（s，3H），3.83（s，3H），2.16（s，3H）。

[0516] 步骤 E：制备 4-（2，6- 二氟 -4- 甲氧苯基）-1，3- 二甲基 -N-（2，4，6- 三氟苯基）-1H- 吡唑 -5- 胺

[0517] 将 5- 溴 -4-（2，6- 二氟 -4- 甲氧苯基）-1，3- 二甲基 -1H- 吡唑（即，步骤 D 的产物）（0.30g，0.94mmol）、乙酸钯（II）（20mg，0.090mmol）、4，5- 双（二苯基膦基）-9，9- 二甲基氧杂蒽（0.11g，0.19mmol）和粉末状的碳酸钾（2.6g，19mmol）在无水的 1，4- 二氧六环（4mL）中混合，并且所得的混合物用 N_2 气流在液面下曝气 10min。一次性加入 2，4，6- 三氟苯胺（0.28g，1.9mmol）并且在氮气中回流下加热反应混合物 22h。冷却所述反应混合物，然后通过 Celite® 硅藻土的助滤剂过滤。所述过滤垫块用乙酸乙酯（20mL）洗涤，并且所述滤液用水（10mL）和盐水（10mL）洗涤，经过 $MgSO_4$ 干燥并浓缩，以留下半固体剩余物。所述的剩余物用柱层析，通过 12g 的硅胶，用梯度的己烷 / 乙酸乙酯（20:1 至 1:3））洗脱纯化，以提供标题化合物（73mg）的半固体。

[0518] ^1H NMR（丙酮 -d_6）δ 6.84（br s，1H），6.68（m，2H），6.43（m，2H），3.77（s，3H），3.75（s，3H），1.99（s，3H）。MS:384amu（AP^+）。

[0519] 合成实例 3

[0520] 制备 4-[[4-（2- 氯 -4- 氟苯基）-1，3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 基] 氧]-3，5- 二氟苯甲腈（化合物 13）

[0521] 步骤 A：制备 4-[（1，3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 基）氧]-3，5- 二氟苯甲腈

[0522] 将碳酸钾（1.38g，10mmol）添加到 2，4- 二氢 -2，5- 二甲基 -3H- 吡唑 -3- 酮

(0.70g,6.3mmol)于N,N-二甲基甲酰胺(15mL)的溶液中。加入3,4,5-三氟苯甲腈(0.94g,6.0mmol),并且反应混合物在氮气氛中在75℃下加热16h,然后使其冷却。将所述反应混合物在介于水(60mL)和乙酸乙酯(30mL)之间分配。所述有机相用水(2×30mL)和盐水(30mL)洗涤,经过$MgSO_4$干燥并浓缩,以提供标题化合物(1.38g)的黄色油。

[0523] ^1H NMR δ 7.36 (m,2H),5.24 (s,1H),3.78 (s,3H),2.16 (s,3H)。

[0524] 步骤B:制备3,5-二氟-4-[(4-碘-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基)氧]苯甲腈

[0525] 4-[(1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基)氧]-3,5-二氟苯甲腈(即,步骤A的产物)(1.38g,5.5mmol)于乙腈(20mL)中的溶液在环境温度下搅拌,并且一次性加入N-碘琥珀酰亚胺(1.35g,6.0mmol)。在回流下将所述反应混合物加热2h,冷却,然后倾入水中(40mL)。用乙酸乙酯(40mL)萃取所得混合物。所述有机相用水(20mL)和饱和的$NaHCO_3$水溶液(20mL)洗涤,经过$MgSO_4$干燥并在减压下浓缩,以提供标题化合物(2.1g)的棕褐色固体。

[0526] ^1H NMR (丙酮-d_6) δ 7.80 (m,2H),3.82 (s,3H),2.09 (s,3H)。MS:376amu (AP^+)。

[0527] 步骤C:制备4-[[4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基]氧]-3,5-二氟苯甲腈

[0528] 向3,5-二氟-4-[(4-碘-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基)氧]苯甲腈(即,步骤B的产物)(1.0g,2.67mmol)于1,4-二氧六环(6mL)中的溶液添加2-氯-4-氟苯硼酸(作为另外一种选择,所述B-(2-氯-4-氟苯基)硼酸)(0.93g,5.33mmol)、二氯(双)三苯基膦钯(II)(作为另外一种选择,所述双(三苯基膦)钯(II)二氯化物)(93mg,0.13mmol)、碳酸钾(0.74g,5.33mmol)和水(4mL)。将所得的混合物在回流下加热5h,使其冷却并在介于水(20mL)和乙酸乙酯(20mL)之间分配。所述有机相经过$MgSO_4$干燥并浓缩。所述的剩余物通过色谱法在硅胶上,用梯度己烷/乙酸乙酯纯化,以获得标题化合物(110mg)的灰白色固体。

[0529] ^1H NMR δ 7.00-7.09(m,3H),6.97(m,1H),6.86(m,1H),3.85(s,3H),2.02(s,3H)。

[0530] 合成实例4

[0531] 制备4-(2,4-二氯苯基)-N-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺(化合物17)

[0532] 步骤A:制备α-乙酰基-2,4-二氯-N-(2,4-二氟苯基)苯硫代乙酰胺

[0533] 将2,4-二氟苯基异硫氰酸酯(0.27mL,2.0mmol)加入搅拌的氢化钠(60%于矿物油)(112mg,2.8mmol)于无水四氢呋喃(4mL)冷却于氮气氛下的冰水浴中的悬浮液中。1-(2,4-二氯苯基)-2-丙酮(570mg,2.8mmol)于四氢呋喃(4mL)中的溶液被经过5min滴加。在5-10℃下搅拌所得的黄色溶液1h。仔细加入水(10mL),并且所述反应混合物用乙酸乙酯(10mL)萃取。所述水相用1N的含水HCl酸化至pH3,然后用乙酸乙酯(20mL)萃取。所述有机提取物用水(10mL)和盐水(10mL)洗涤,经过$MgSO_4$干燥并浓缩,以留下固体。所述固体用己烷/乙酸乙酯(2:1)磨碎,收集在玻璃料上并风干,以提供标题化合物(240mg)的白色固体。MS:373amu (AP^+)。

[0534] 步骤B:制备4-(2,4-二氯苯基)-N-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺

[0535] 将乙酸(50μL)和甲基肼(41μL)加入搅拌的α-乙酰基-2,4-二氯-N-(2,4-二氟苯基)苯硫代乙酰胺(238mg,0.64mmol)于乙醇(4mL)的悬浮液中。将反应混合物在回流

下加热 2h，并使其冷却。然后用乙酸乙酯（10mL）稀释所述反应混合物并用 1N 的含水 NaOH（10mL）、水（10mL）和盐水（10mL）洗涤，经过 $MgSO_4$ 干燥并浓缩，以留下固体剩余物。所述的剩余物用柱层析，通过 5g 的硅胶，用梯度的己烷 / 乙酸乙酯（2:1 至 1:1）纯化，以提供标题化合物（170mg）的固体。

[0536] ^1H NMR δ 7.43（s,1H），7.19（m,1H），7.07（m,1H），6.78（m,1H），6.62（m,1H），6.37（m,1H），5.22（br s,1H），3.70（s,3H），2.18（s,3H）。MS:368amu（AP^+）。

[0537] 合成实例 5

[0538] 制备 4-（2- 氯 -4- 氟苯基）- α -（2,4- 二氟苯基）-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 甲醇（化合物 122）

[0539] 5- 溴 -4-（2- 氯 -4- 氟苯基）-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑（即，合成实例 1，步骤 B 的产物）（0.25g,0.82mmol）被溶解于无水四氢呋喃（12mL）中，并且所述混合物在氮气氛中干冰 / 丙酮浴下冷却。经过 5 分钟滴加 n- 丁基锂的己烷溶液（2.0M,0.49mL,0.98mmol）。在 15 分钟后，缓慢滴加 2,4- 二氟苯甲醛（0.09mL,0.82mmol）于无水四氢呋喃（3mL）的溶液，致使所述黑红色溶液变浅为黄色。在 45 分钟后，所述反应混合物通过加入饱和的 NH_4Cl 水溶液（～ 20mL）猝灭，并使其温热至环境温度。该混合物用乙酸乙酯萃取，并用饱和的 NH_4Cl 水溶液（25mL）并用盐水洗涤所述有机相，经过 Na_2SO_4 干燥并浓缩，以留下粘稠的剩余物。该剩余物由柱层析，通过硅胶，用梯度乙酸乙酯于己烷中（7% 至 10%）洗脱纯化，以提供标题化合物（109mg）的白色半固体。

[0540] ^1H NMR δ 7.5（m,1H），7.1（m,2H），7.0（m,1H），6.85（m,2H），6.0（br s,1H），5.9（s,1H），3.8（s,3H），2.1（s,3H）。MS:367amu（AP^+）。

[0541] 合成实例 6

[0542] 制备 4-[[1,3- 二甲基 -4-（2,4,6- 三氟苯基）-1H- 吡唑 -5- 基] 氧]-3,5- 二氟苯甲腈（化合物 8）

[0543] 步骤 A：制备 2,4,6- 三氟苯乙酸甲酯

[0544] 在环境温度下搅拌 2,4,6- 三氟苯乙酸（5.00g,26.3mmol）于甲醇（25mL）中的溶液，并且滴加亚硫酰氯（6mL，～ 3 当量），导致反应混合物的温度达到 60℃。使反应混合物冷却至环境温度并搅拌 3h。在冰冷却下，加入水（25mL）。用乙酸乙酯（2×100mL）萃取混合物。接着，混合的有机相用水（2×）、饱和的碳酸氢钠水溶液和盐水洗涤，然后干燥（$MgSO_4$）。浓缩以提供标题化合物（5.38g）的澄清油。

[0545] ^1H NMR δ 6.68（m,2H），3.72（s,3H），3.66（s,2H）。

[0546] 步骤 B：制备 α - 乙酰基 -2,4,6- 三氟苯乙酸甲酯

[0547] 向在氮气氛中搅拌的，并且冷却至 -65℃的内部温度的商业获得的双（三甲基甲硅烷基）酰胺锂（1.0M,21.0mL）的四氢呋喃溶液中经过 30 分钟滴加 2,4,6- 三氟苯乙酸甲酯（即，步骤 A 的产物）（2.04g,10.0mmol）溶解于干燥四氢呋喃（10mL）中的溶液。将所述反应混合物搅拌额外的 30 分钟，然后同时保持 -65℃的温度，滴加新鲜蒸馏的乙酰氯（0.80mL,11mmol）于干燥四氢呋喃（3mL）的溶液。使所述反应混合物缓慢温热至环境温度，然后加入水（30mL）。用乙酸乙酯（60mL）萃取所得混合物。所述水相用 1N 盐酸酸化，并用乙酸乙酯（60mL）萃取。由于薄层色谱分析显示除了附加的所需的产物以外，第二次提取物包含明显的极性杂质，故仅第一次乙酸乙酯提取物被保留下来。所述第一乙酸乙酯提取物还被顺

序地用 1N 的盐酸、水和盐水洗涤，干燥（$MgSO_4$），并浓缩，以提供标题化合物（1.86g）的澄清油。

[0548] ^1H NMR δ 6.69（m,2H），3.7（m,1H 和 s,3H），1.87（s,3H）；在 13.2ppm 和 4.9ppm 微量共振显示存在烯醇式互变异构体。

[0549] 步骤 C：制备 1,3- 二甲基 -4-（2,4,6- 三氟苯基）-1H- 吡唑 -5- 醇

[0550] α - 乙酰基 -2,4,6- 三氟苯乙酸甲酯（即，步骤 B 的产物）（2.46g,10.0mmol）于甲醇（15mL）中的溶液被加入甲基肼（0.665mL,12.5mmol）中，并且所述在环境温度下搅拌 3 天。加入含水的柠檬酸溶液（1M,10mL），然后加入水（50mL）。用乙酸乙酯（2×50mL）萃取混合物。混合的乙酸乙酯提取物顺序地用水和盐水洗涤，干燥（$MgSO_4$），并浓缩以留下黄色固体。该固体在小体积的乙酸乙酯（～ 5mL）中悬浮，逐步加入相同体积的己烷，并且搅拌所述悬浮液 30 分钟。将所述固体组分收集在玻璃料上，用小部分的乙酸乙酯 / 己烷（1:1 和 1:2v:v），并使其在空气中干燥以提供白色固体（1.02g）。蒸发所述母液并如已经描述的，用少量体积的乙酸乙酯和己烷处理所得的剩余物，从而提供附加的 0.13g 的包含标题化合物的固体（总计 1.15g）。通过 LC/MS 分析混合的固体显示质量 242（AP^+）的主要组分和微量组分，随后通过反相 LC 洗脱，也具有 242 的质量（AP^+），因此为标题化合物的结构异构体。组分的表观比率为 94:6。

[0551] ^1H NMR（丙酮 -d_6）δ 6.95（m,2H），3.52（s,3H），1.98（s,3H）；未在该溶剂中观察到 5- 羟基共振。

[0552] 步骤 D：制备 4-[[1,3- 二甲基 -4-（2,4,6- 三氟苯基）-1H- 吡唑 -5- 基]氧]-3,5- 二氟苯甲腈

[0553] 1,3- 二甲基 -4-（2,4,6- 三氟苯基）-1H- 吡唑 -5- 醇（即，步骤 C 的产物）（104mg,0.43mmol）于无水的 N,N- 二甲基甲酰胺（2.5mL）的溶液在氮气氛中，在冰 - 水浴中冷却，并且一次性加入氢化钠（于矿物油中 60% 悬浮液，20mg,0.46mmol）。15 分钟后，一次性加入 3,4,5- 三氟苯甲腈（101mg,0.64mmol）。使反应混合物达到环境温度，然后将其在 40℃加热 2.5h。加入水（～ 10mL），并且所述混合物用乙酸乙酯萃取（2× ～ 10mL）。混合的乙酸乙酯提取物顺序地用水（3×10mL）和盐水洗涤，干燥（$MgSO_4$），并在减压下浓缩。在硅胶（5g）上的色谱法，用 2:1 己烷 - 乙酸乙酯混合物洗脱，提供包含与其结构异构体 92:8 混合物的标题化合物的产物（51mg）。

[0554] ^1H NMR δ 7.1（m,2H），6.5-6.6（m,2H），3.85（s,3H），2.05（s,3H）。MS:380amu（AP+）。

[0555] 合成实例 7

[0556] 制备 4-（2- 溴 -4- 氟苯基）-N-（2- 氯 -6- 氟苯基）-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺（化合物 240）

[0557] 步骤 A：制备 1-（2- 溴 -4- 氟苯基）-2- 丙酮

[0558] 将甲醇钠在甲醇的溶液（25%,34mL,157mmol）中与甲苯（200mL）混合。然后使用分水器在 90℃下蒸馏出甲醇。溶液冷却至 70℃之后，由滴液漏斗经过 20min，伴随着机械搅拌，添加溶解于乙酸乙酯（40mL）中的 2- 溴 -4- 氟苯乙腈（21.4g,100mmol）。这时，加入附加的甲苯（150mL），以有利于搅开大量的浅粉色沉淀。将反应混合物倾倒在水中并且分离有机相。酸化水相并用乙酸乙酯萃取。干燥乙酸乙酯相并在减压下浓缩以提供为粗制油的中

间体化合物 α - 乙酰基 -2- 溴 -4- 氟苯乙腈。

[0559] 所述粗制油被溶解于硫酸(60%,170mL)并回流 6.5h。然后用己烷(2×100mL)萃取所述反应混合物,并且混合的己烷提取物用水和盐水洗涤,干燥($MgSO_4$)并在减压下浓缩,以产生标题化合物(14.7g)的黄色油,其在步骤 C 中未进一步纯化就使用了。

[0560] ^1H NMR δ 7.33 (m,1H),7.18 (m,1H),7.01 (m,1H),3.85 (s,2H),2.23 (s,3H)。

[0561] 步骤 B :制备 1- 氯 -3- 氟 -2- 异氰硫基苯

[0562] 向 2- 氯 -6- 氟苯胺(5.0g,34mmol)于氯苯(52mL)中的溶液添加硫光气(二氯硫化碳)(5.1g,45mmol)和 DMF (0.27mL)。回流反应混合物 2h,然后浓缩以留下标题化合物(6.15g)的棕色油,其用于步骤 C 中没有进一步纯化。

[0563] ^1H NMR δ 7.18 (m,2H),7.07 (m,1H)。

[0564] 步骤 C :制备 4- (2- 溴 -4- 氟苯基)-N- (2- 氯 -6- 氟苯基)-1,3- 二甲基 -1H- 吡唑 -5- 胺

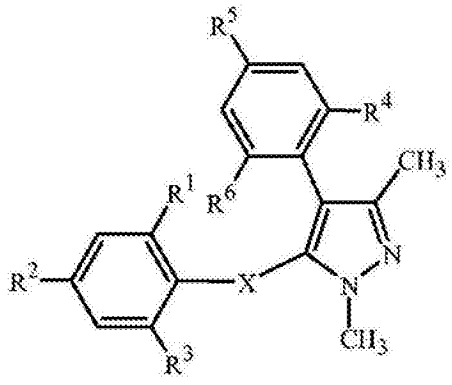
[0565] 在 0℃下,经过 5 分钟,向叔丁醇钾(0.41g,3.3mmol)于 THF (20mL)中的溶液添加 1- (2- 溴 -4- 氟苯基)-2- 丙酮(即,步骤 A 的产物)(0.70g,3.0mmol)于 THF (10mL)中的溶液。继续搅拌 1h,然后将温度下降至 -10℃。经过 6 分钟,添加 1- 氯 -3- 氟 -2- 异硫氰基苯(即,步骤 B 的产物)(0.57g,3.0mmol)于 THF (10mL)中的溶液并且搅拌持续 15 分钟。加入碘甲烷(0.54g,3.8mmol),并且移除冷却浴以提供包含中间体化合物 α - 乙酰基 -2- 溴 -N- (2- 氯 -6- 氟苯基)-4- 氟苯硫代乙酰胺的反应混合物。5min 后,一连串地加入水(0.2mL,11mmol)、冰醋酸(0.53mL,9.1mmol)和甲基肼(0.81mL,15mmol),并且反应混合物加热至回流 6h。然后在减压下浓缩粗制反应混合物并通过 MPLC (0 至 100% 乙酸乙酯于己烷中作为洗脱液)纯化以提供为灰白色固体的标题产物,本发明的化合物(0.55g)。

[0566] ^1H NMR δ 7.24 (m,1H),7.04 (m,1H),6.95 (m,1H),6.87 (m,1H),6.78 (m,1H),6.68 (m,1H),5.45 (d,1H),3.80 (s,3H),2.10 (s,3H)。

[0567] 通过本文所述的方法以及本领域已知的方法,可制备在下表中公开的化合物。以下表中使用如下缩写 :Me 表示甲基,MeO 表示甲氧基,EtO 表示乙氧基,并且 CN 表示氰基。由于对称性,R^1 可与 R^3 相互交换,并且 R^4 可与 R^6 相互交换,如果 R^1、R^3、R^4 和 R^6 的定义允许的话。

[0568] 表 1

[0569]



[0570] R^4 为 F,R^5 为 H,R^6 为 H,并且 X 为 NH。

[0571]

R^1	R^2	R^3	R^1	R^2	R^3
F	H	H	F	H	F
F	F	H	F	F	F
F	CN	F	F	MeO	F
F	EtO	F	F	Cl	H
F	Cl	Cl	F	H	Cl
F	Br	H	F	H	Br
F	Cl	F	F	Br	F
F	I	H	F	F	I
F	I	F	F	CN	H
F	MeO	H	F	EtO	H
Cl	H	H	Cl	H	Cl
Cl	Cl	H	Cl	Cl	Cl
Cl	CN	Cl	Cl	MeO	Cl
Cl	EtO	Cl	Cl	F	H
Cl	F	F	Cl	F	Cl
Cl	Br	H	Cl	H	Br
Cl	Br	Br	Cl	Br	Cl
Cl	I	H	Cl	CN	H
Cl	MeO	H	Cl	EtO	H
Br	H	H	Br	F	H
Br	Cl	H	Br	Br	H
Br	F	F	Br	Br	F
Br	Cl	F	Br	F	Cl
Br	Cl	Cl	Br	F	Br
Br	CN	Br	Br	MeO	Br
Br	EtO	Br	Br	CN	H
Br	MeO	H	Br	EtO	H
Br	I	H	I	H	H
I	F	H	I	F	F

[0572]

R^1	R^2	R^3	R^1	R^2	R^3
I	Cl	F	I	Cl	Cl
Br	H	Cl	Br	H	Br
I	H	F	I	H	Cl
Me	H	H	Me	H	F
Me	F	H	Me	F	F
Me	CN	F	Me	MeO	F
Me	EtO	F	Me	Cl	H
Me	Cl	Cl	Me	H	Cl
Me	Br	H	Me	H	Br
Me	Cl	F	Me	Br	F
Me	I	H	Me	F	I
Me	I	F	Me	CN	H
Me	MeO	H	Me	EtO	H
Me	H	Me	Me	Cl	Me

[0573] 本公开还包括表 2 至表 180，每个表的构造与上表 1 相同，不同的是表 1 中的行标

题(即“R^4为F,R^5为H,R^6为H,并且X为NH。”)被下文所示的相应的行标题替换。例如,在表2中,行标题为“R^4为F,R^5为H,R^6为F,并且X为NH。”,并且R^4、R^5和R^6如在上文表1中所限定。因此,在表2中的第一条具体公开了4-(2,6-二氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺)。

[0574]

表	行标题	表	行标题
2	R^4为F，R^5为H，R^6为F，并且X为NH。	92	R^4为Cl，R^5为F，R^6为H，并且X为O。
3	R^4为F，R^5为H，R^6为Cl，并且X为NH。	93	R^4为Cl，R^5为F，R^6为Cl，并且X为O。
4	R^4为F，R^5为H，R^6为Br，并且X为NH。	94	R^4为Cl，R^5为I，R^6为H，并且X为O。
5	R^4为F，R^5为Br，R^6为H，并且X为NH。	95	R^4为Cl，R^5为EtO，R^6为Cl，并且X为O。
6	R^4为F，R^5为Br，R^6为F，并且X为NH。	96	R^4为Cl，R^5为EtO，R^6为H，并且X为O。
7	R^4为F，R^5为Cl，R^6为Cl，并且X为NH。	97	R^4为Cl，R^5为MeO，R^6为Cl，并且X为O。
8	R^4为F，R^5为Cl，R^6为F，并且X为NH。	98	R^4为Cl，R^5为MeO，R^6为H，并且X为O。
9	R^4为F，R^5为Cl，R^6为H，并且X为NH。	99	R^4为Br，R^5为H，R^6为H，并且X为O。

[0575]

表	行标题	表	行标题
10	R^4为F，R^5为-CN，R^6为F，并且X为NH。	100	R^4为Br，R^5为Br，R^6为H，并且X为O。
11	R^4为F，R^5为-CN，R^6为H，并且X为NH。	101	R^4为Br，R^5为Br，R^6为F，并且X为O。
12	R^4为F，R^5为F，R^6为H，并且X为NH。	102	R^4为Br，R^5为Cl，R^6为H，并且X为O。
13	R^4为F，R^5为F，R^6为F，并且X为NH。	103	R^4为Br，R^5为Cl，R^6为F，并且X为O。
14	R^4为F，R^5为F，R^6为I，并且X为NH。	104	R^4为Br，R^5为Cl，R^6为Cl，并且X为O。
15	R^4为F，R^5为I，R^6为H，并且X为NH。	105	R^4为Br，R^5为CN，R^6为Br，并且X为O。
16	R^4为F，R^5为I，R^6为F，并且X为NH。	106	R^4为Br，R^5为CN，R^6为H，并且X为O。
17	R^4为F，R^5为EtO，R^6为F，并且X为NH。	107	R^4为Br，R^5为F，R^6为F，并且X为O。
18	R^4为F，R^5为EtO，R^6为H，并且X为NH。	108	R^4为Br，R^5为F，R^6为H，并且X为O。
19	R^4为F，R^5为MeO，R^6为F，并且X为NH。	109	R^4为Br，R^5为F，R^6为Cl，并且X为O。
20	R^4为F，R^5为MeO，R^6为H，并且X为NH。	110	R^4为Br，R^5为F，R^6为Br，并且X为O。
21	R^4为Cl，R^5为H，R^6为H，并且X为NH。	111	R^4为Br，R^5为I，R^6为H，并且X为O。
22	R^4为Cl，R^5为H，R^6为Cl，并且X为NH。	112	R^4为Br，R^5为EtO，R^6为Br，并且X为O。
23	R^4为Cl，R^5为H，R^6为Br，并且X为NH。	113	R^4为Br，R^5为EtO，R^6为H，并且X为O。
24	R^4为Cl，R^5为Br，R^6为H，并且X为NH。	114	R^4为Br，R^5为MeO，R^6为Br，并且X为O。
25	R^4为Cl，R^5为Br，R^6为Br，并且X为NH。	115	R^4为Br，R^5为MeO，R^6为H，并且X为O。
26	R^4为Cl，R^5为Br，R^6为Cl，并且X为NH。	116	R^4为I，R^5为H，R^6为H，并且X为O。
27	R^4为Cl，R^5为Cl，R^6为H，并且X为NH。	117	R^4为I，R^5为Cl，R^6为F，并且X为O。
28	R^4为Cl，R^5为Cl，R^6为Cl，并且X为NH。	118	R^4为I，R^5为Cl，R^6为Cl，并且X为O。
29	R^4为Cl，R^5为-CN，R^6为Cl，并且X为NH。	119	R^4为I，R^5为F，R^6为H，并且X为O。

[0576]

表	行标题
30	R^4为 Cl，R^5为-CN，R^6为 H，并且 X 为 NH。
31	R^4为 Cl，R^5为 F，R^6为 F，并且 X 为 NH。
32	R^4为 Cl，R^5为 F，R^6为 H，并且 X 为 NH。
33	R^4为 Cl，R^5为 F，R^6为 Cl，并且 X 为 NH。
34	R^4为 Cl，R^5为 I，R^6为 H，并且 X 为 NH。
35	R^4为 Cl，R^5为 EtO，R^6为 Cl，并且 X 为 NH。
36	R^4为 Cl，R^5为 EtO，R^6为 H，并且 X 为 NH。
37	R^4为 Cl，R^5为 MeO，R^6为 Cl，并且 X 为 NH。
38	R^4为 Cl，R^5为 MeO，R^6为 H，并且 X 为 NH。
39	R^4为 Br，R^5为 H，R^6为 H，并且 X 为 NH。
40	R^4为 Br，R^5为 Br，R^6为 H，并且 X 为 NH。
41	R^4为 Br，R^5为 Br，R^6为 F，并且 X 为 NH。
42	R^4为 Br，R^5为 Cl，R^6为 H，并且 X 为 NH。
43	R^4为 Br，R^5为 Cl，R^6为 F，并且 X 为 NH。
44	R^4为 Br，R^5为 Cl，R^6为 Cl，并且 X 为 NH。
45	R^4为 Br，R^5为 CN，R^6为 Br，并且 X 为 NH。
46	R^4为 Br，R^5为-CN，R^6为 H，并且 X 为 NH。
47	R^4为 Br，R^5为 F，R^6为 F，并且 X 为 NH。
48	R^4为 Br，R^5为 F，R^6为 H，并且 X 为 NH。
49	R^4为 Br，R^5为 F，R^6为 Cl，并且 X 为 NH。
120	R^4为 I，R^5为 F，R^6为 F，并且 X 为 O。
121	R^4为 F，R^5为 H，R^6为 H，并且 X 为 CHOH。
122	R^4为 F，R^5为 H，R^6为 F，并且 X 为 CHOH。
123	R^4为 F，R^5为 H，R^6为 Cl，并且 X 为 CHOH。
124	R^4为 F，R^5为 H，R^6为 Br，并且 X 为 CHOH。
125	R^4为 F，R^5为 Br，R^6为 H，并且 X 为 CHOH。
126	R^4为 F，R^5为 Br，R^6为 F，并且 X 为 CHOH。
127	R^4为 F，R^5为 Cl，R^6为 Cl，并且 X 为 CHOH。
128	R^4为 F，R^5为 Cl，R^6为 F，并且 X 为 CHOH。
129	R^4为 F，R^5为 Cl，R^6为 H，并且 X 为 CHOH。
130	R^4为 F，R^5为 CN，R^6为 F，并且 X 为 CHOH。
131	R^4为 F，R^5为 CN，R^6为 H，并且 X 为 CHOH。
132	R^4为 F，R^5为 F，R^6为 H，并且 X 为 CHOH。
133	R^4为 F，R^5为 F，R^6为 F，并且 X 为 CHOH。
134	R^4为 F，R^5为 F，R^6为 I，并且 X 为 CHOH。
135	R^4为 F，R^5为 I，R^6为 H，并且 X 为 CHOH。
136	R^4为 F，R^5为 I，R^6为 F，并且 X 为 CHOH。
137	R^4为 F，R^5为 EtO，R^6为 F，并且 X 为 CHOH。
138	R^4为 F，R^5为 EtO，R^6为 H，并且 X 为 CHOH。
139	R^4为 F，R^5为 MeO，R^6为 F，并且 X 为 CHOH。

[0577]

表	行标题	表	行标题
50	R^4为 Br，R^5为 F，R^6为 Br，并且 X 为 NH。	140	R^4为 F，R^5为 MeO，R^6为 H，并且 X 为 CHOH。
51	R^4为 Br，R^5为 I，R^6为 H，并且 X 为 NH。	141	R^4为 Cl，R^5为 H，R^6为 H，并且 X 为 CHOH。
52	R^4为 Br，R^5为 EtO，R^6为 Br，并且 X 为 NH。	142	R^4为 Cl，R^5为 H，R^6为 Cl，并且 X 为 CHOH。
53	R^4为 Br，R^5为 EtO，R^6为 H，并且 X 为 NH。	143	R^4为 Cl，R^5为 H，R^6为 Br，并且 X 为 CHOH。
54	R^4为 Br，R^5为 MeO，R^6为 Br，并且 X 为 NH。	144	R^4为 Cl，R^5为 Br，R^6为 H，并且 X 为 CHOH。
55	R^4为 Br，R^5为 MeO，R^6为 H，并且 X 为 NH。	145	R^4为 Cl，R^5为 Br，R^6为 Br，并且 X 为 CHOH。
56	R^4为 I，R^5为 H，R^6为 H，并且 X 为 NH。	146	R^4为 Cl，R^5为 Br，R^6为 Cl，并且 X 为 CHOH。
57	R^4为 I，R^5为 Cl，R^6为 F，并且 X 为 NH。	147	R^4为 Cl，R^5为 Cl，R^6为 H，并且 X 为 CHOH。
58	R^4为 I，R^5为 Cl，R^6为 Cl，并且 X 为 NH。	148	R^4为 Cl，R^5为 Cl，R^6为 Cl，并且 X 为 CHOH。
59	R^4为 I，R^5为 F，R^6为 H，并且 X 为 NH。	149	R^4为 Cl，R^5为 CN，R^6为 Cl，并且 X 为 CHOH。
60	R^4为 I，R^5为 F，R^6为 F，并且 X 为 NH。	150	R^4为 Cl，R^5为 CN，R^6为 H，并且 X 为 CHOH。
61	R^4为 F，R^5为 H，R^6为 H，并且 X 为 O。	151	R^4为 Cl，R^5为 F，R^6为 F，并且 X 为 CHOH。
62	R^4为 F，R^5为 H，R^6为 F，并且 X 为 O。	152	R^4为 Cl，R^5为 F，R^6为 H，并且 X 为 CHOH。
63	R^4为 F，R^5为 H，R^6为 Cl，并且 X 为 O。	153	R^4为 Cl，R^5为 F，R^6为 Cl，并且 X 为 CHOH。
64	R^4为 F，R^5为 H，R6 为 Br，并且 X 为 O。	154	R^4为 Cl，R^5为 I，R^6为 H，并且 X 为 CHOH。
65	R^4为 F，R^5为 Br，R^6为 H，并且 X 为 O。	155	R^4为 Cl，R^5为 EtO，R^6为 Cl，并且 X 为 CHOH。
66	R^4为 F，R^5为 Br，R^6为 F，并且 X 为 O。	156	R^4为 Cl，R^5为 EtO，R^6为 H，并且 X 为 CHOH。
67	R^4为 F，R^5为 Cl，R^6为 Cl，并且 X 为 O。	157	R^4为 Cl，R^5为 MeO，R^6为 Cl，并且 X 为 CHOH。
68	R^4为 F，R^5为 Cl，R^6为 F，并且 X 为 O。	158	R^4为 Cl，R^5为 MeO，R^6为 H，并且 X 为 CHOH。
69	R^4为 F，R^5为 Cl，R^6为 H，并且 X 为 O。	159	R^4为 Br，R^5为 H，R^6为 H，并且 X 为 CHOH。

[0578]

表	行标题	表	行标题
70	R^4为F，R^5为CN，R^6为F，并且X为O。	160	R^4为Br，R^5为Br，R^6为H，并且X为CHOH。
71	R^4为F，R^5为CN，R^6为H，并且X为O。	161	R^4为Br，R^5为Br，R^6为F，并且X为CHOH。
72	R^4为F，R^5为F，R^6为H，并且X为O。	162	R^4为Br，R^5为Cl，R^6为H，并且X为CHOH。
73	R^4为F，R^5为F，R^6为F，并且X为O。	163	R^4为Br，R^5为Cl，R^6为F，并且X为CHOH。
74	R^4为F，R^5为F，R^6为I，并且X为O。	164	R^4为Br，R^5为Cl，R^6为Cl，并且X为CHOH。
75	R^4为F，R^5为I，R^6为H，并且X为O。	165	R^4为Br，R^5为CN，R^6为Br，并且X为CHOH。
76	R^4为F，R^5为I，R^6为F，并且X为O。	166	R^4为Br，R^5为CN，R^6为H，并且X为CHOH。
77	R^4为F，R^5为EtO，R^6为F，并且X为O。	167	R^4为Br，R^5为F，R^6为F，并且X为CHOH。
78	R^4为F，R^5为EtO，R^6为H，并且X为O。	168	R^4为Br，R^5为F，R^6为H，并且X为CHOH。
79	R^4为F，R^5为MeO，R^6为F，并且X为O。	169	R^4为Br，R^5为F，R^6为Cl，并且X为CHOH。
80	R^4为F，R^5为MeO，R^6为H，并且X为O。	170	R^4为Br，R^5为F，R^6为Br，并且X为CHOH。
81	R^4为Cl，R^5为H，R^6为H，并且X为O。	171	R^4为Br，R^5为I，R^6为H，并且X为CHOH。
82	R^4为Cl，R^5为H，R^6为Cl，并且X为O。	172	R^4为Br，R^5为EtO，R^6为Br，并且X为CHOH。
83	R^4为Cl，R^5为H，R^6为Br，并且X为O。	173	R^4为Br，R^5为EtO，R^6为H，并且X为CHOH。
84	R^4为Cl，R^5为Br，R^6为H，并且X为O。	174	R^4为Br，R^5为MeO，R^6为Br，并且X为CHOH。
85	R^4为Cl，R^5为Br，R^6为Br，并且X为O。	175	R^4为Br，R^5为MeO，R^6为H，并且X为CHOH。
86	R^4为Cl，R^5为Br，R^6为Cl，并且X为O。	176	R^4为I，R^5为H，R^6为H，并且X为CHOH。
87	R^4为Cl，R^5为Cl，R^6为H，并且X为O。	177	R^4为I，R^5为Cl，R^6为F，并且X为CHOH。
88	R^4为Cl，R^5为Cl，R^6为Cl，并且X为O。	178	R^4为I，R^5为Cl，R^6为Cl，并且X为CHOH。
89	R^4为Cl，R^5为CN，R^6为Cl，并且X为O。	179	R^4为I，R^5为F，R^6为H，并且X为CHOH。

[0579]

表	行标题	表	行标题
90	R^4为Cl，R^5为CN，R^6为H，并且X为O。	180	R^4为I，R^5为F，R^6为F，并且X为CHOH。
91	R^4为Cl，R^5为F，R^6为F，并且X为O。		

[0580] 制剂／效用

[0581] 选自式1的化合物、其N-氧化物及其盐的化合物，或包含具有至少一种如在发明内容中所述的附加的杀真菌化合物的混合物(即，组合物)，一般在进一步的组合物，即，制剂中将被用于提供杀真菌活性成分，所述组合物具有至少一种用作载体的附加组分，所述附加组分选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂。选择制剂或组合物成分，使其与活性成分的物理性质、施用方式和环境因素如土壤类型、湿度和温度相符合。

[0582] 可以多种方式配制组分(a)(即至少一种式1的化合物、其N氧化物或盐)和组分(b)(例如选自如上所述的(b1)至(b46)以及它们的盐)和／或一种或多种其它生物学活性化合物或试剂(即杀昆虫剂、其它杀真菌剂、杀线虫剂、杀螨剂、除草剂以及其它生物试剂)的混合物，包括：

[0583] (i)可单独配制组分(a)、组分(b)和／或一种或多种其它生物学活性化合物或试剂，并且单独施用或者以适当的重量比同时施用，例如为罐内混合物形式；或者

[0584] (ii)以适当的重量比将组分(a)、组分(b)和／或一种或多种其它生物学活性化合物或试剂配制在一起。

[0585] 有用的制剂包括液体组合物和固体组合物。液体组合物包括溶液(包括可乳化的浓缩物)、悬浮液、乳液(包括微乳液和／或悬乳液)等，它们可以任选地被稠化成凝胶。水性液体组合物的一般类型为可溶性浓缩物、悬浮液浓缩物、胶囊悬浮液、浓缩乳液、微乳液和悬乳液。非水性液体组合物的一般类型为可乳化的浓缩物、可微乳化的浓缩物、可分散浓缩物和油分散体。

[0586] 固体组合物的一般类型为尘粉、粉末、颗粒、小丸、粒料、锭剂、片剂、填充薄膜(包括种子包衣)等，它们可以是水分散性的(“可润湿 的”)或水溶性的。由成膜溶液或可流动的悬浮液形成的膜和包衣尤其可用于种子处理。活性成分可被(微)包封，并且进一步形成悬浮液或固体制剂；作为另外一种选择，可将含有活性成分的整个制剂包封(或“包覆”)。包封可以控制或延迟活性成分的释放。可乳化的颗粒结合了可乳化的浓缩物制剂和干颗粒制剂两者的优点。高强度组合物主要用作其它制剂的中间体。

[0587] 值得注意的是组合物实施例，其中使包含式1(或其N-氧化物或其盐)的化合物的固体组合物颗粒与包含组分(b)的固体组合物颗粒混合。这些混合物可进一步与包含附加农业保护剂的颗粒混合。作为另外一种选择，可将两种或更多种农业保护剂(例如组分(a)(式1)的化合物、组分(b)化合物、不是组分(a)或(b)的农业保护剂)混合于一组颗粒固体组合物中，然后与一组或多组包含一种或多种附加农业保护剂的固体组合物颗粒混合。这些颗粒的混合可根据PCT专利公布WO94/24861中的一般颗粒混合物公开，或更优选根据美国专利公开6,022,552中的均匀颗粒混合指导。

[0588] 可喷雾的制剂通常在喷雾之前分散在合适的介质中。将此类液体制剂和固体制剂配制成易于在喷雾介质(通常是水)中稀释的制剂。喷雾体积可以在每公顷约一升至几千升

的范围内，但更典型地在每公顷约十升至几百升的范围内。可喷雾的制剂可在水槽中与水或另一种合适的介质混合，用于通过空气或地面施用于处理叶子，或施用到植物的生长介质中。液体和干制剂可以直接定量加入滴灌系统中，或在种植期间定量加入垄沟中。液体和固体制剂可以在种植之前的种子处理时施用于作物和其它期望的植物的种子上，以便通过全身吸收来保护发育中的根和其它地面下的植物部分和 / 或叶。

[0589] 所述制剂通常将包含有效量的活性成分、稀释剂和表面活性剂，其在如下的大概的范围内，总和为按重量计 100%。

[0590]

	重量%		
	活性成分	稀释剂	表面活性剂
水分散性和水溶性的颗粒、片剂和粉末	0.001–90	0–99.999	0–15

[0591]

油分散体、悬浮液、乳液、溶液（包括可乳化的浓缩物）	1–50	40–99	0–50
尘粉	1–25	70–99	0–5
颗粒和小丸	0.001–99	5–99.999	0–15
高强度组合物	90–99	0–10	0–2

[0592] 固体稀释剂包括例如粘土例如膨润土、蒙脱石、绿坡缕石和高岭土、石膏、纤维素、二氧化钛、氧化锌、淀粉、糊精、糖（例如乳糖、蔗糖）、硅石、滑石、云母、硅藻土、尿素、碳酸钙、碳酸钠和碳酸氢钠以及硫酸钠。典型的固体稀释剂描述于 Watkins 等人的 Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers 第 2 版（Dorland Books，Caldwell，New Jersey）中。

[0593] 液体稀释剂包括，例如，水、N,N- 二甲基烷酰胺（例如 N,N- 二甲基甲酰胺）、柠檬烯、二甲基亚砜、N- 烷基吡咯烷酮（例如 N- 甲基吡咯烷酮）、乙二醇、三甘醇、丙二醇、双丙二醇、聚丙二醇、碳酸亚丙酯、碳酸亚丁酯、石蜡（例如白矿物油、正链烷烃、异链烷烃）、烷基苯、烷基萘、甘油、三乙酸甘油酯、山梨醇、甘油三乙酸酯、芳烃、脱芳构化脂族化合物、烷基苯、烷基萘、酮（如环己酮、2- 庚酮、异佛尔酮和 4- 羟基 -4- 甲基 -2- 戊酮）、乙酸酯（如乙酸异戊酯、乙酸己酯、乙酸庚酯、乙酸辛酯、乙酸壬酯、乙酸十三烷基酯和乙酸异冰片酯）、其它酯（如烷基化乳酸酯、二元酯和 γ - 丁内酯）、并且可以是直链、支链、饱和或不饱和的醇（如甲醇、乙醇、正丙醇、异丙醇、正丁醇、异丁醇、正己醇、2- 乙基己醇、正辛醇、癸醇、异癸醇、异十八醇、鲸蜡醇、月桂醇、十三烷醇、油醇、环己醇、四氢糠醇、双丙酮醇和苄醇）。液体稀释剂还包括饱和的和不饱和的脂肪酸（通常为 C_6-C_{22}）的甘油酯，如植物种子和果实的油（例如橄榄油，蓖麻油，亚麻籽油，芝麻油，玉米油，花生油，葵花籽油，葡萄籽油，红花油，棉籽油，豆油，油菜籽油，椰子油和棕榈仁油），动物源脂肪（例如牛脂，猪脂，猪油，鳕鱼肝油，鱼油），以及它们的混合物。液体稀释剂还包括烷基化（例如甲基化、乙基化、丁基化）的脂肪酸，其中脂肪酸可以通过源自植物和动物的甘油酯的水解获得，并且可通 过蒸馏进行纯化。典型的液体稀释剂描述于 Marsden 的 Solvents Guide 第 2 版（Interscience，New York，1950）中。

[0594] 本发明的固体组合物和液体组合物通常包含一种或多种表面活性剂。当加至液体中时，表面活性剂（还被称为“表面活性试剂”）通常修饰、最通常降低液体的表面张力。根

据表面活性剂分子中的亲水基团和亲脂基团的性质，表面活性剂可用作润湿剂、分散剂、乳化剂或消泡剂。

[0595] 表面活性剂可分为非离子表面活性剂、阴离子表面活性剂或阳离子表面活性剂。可用于本发明的组合物的非离子表面活性剂包括但不限于：醇烷氧基化物诸如基于天然醇和合成醇(其可以是支链或直链的)并且由醇和环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们混合物制得的醇烷氧基化物；胺乙氧基化物、链烷醇酰胺和乙氧基化链烷醇酰胺；烷氧基化甘油三酯，诸如乙氧基化的大豆油、蓖麻油和油菜籽油；烷基苯酚烷氧基化物，诸如辛基苯酚乙氧基化物、壬基苯酚乙氧基化物、二壬基苯酚乙氧基化物和十二烷基苯酚乙氧基化物(由苯酚和环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们混合物制得)；环氧乙烷或环氧丙烷制得的嵌段聚合物和其中末端嵌段由环氧丙烷制得的反式嵌段聚合物；乙氧基化脂肪酸；乙氧基化脂肪酯和油；乙氧基化甲酯；乙氧基化三苯乙烯基苯酚(包括由环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们混合物制得的那些)；脂肪酸酯、甘油酯、基于羊毛脂的衍生物、多乙氧基化酯(诸如多乙氧基化脱水山梨糖醇脂肪酸酯、多乙氧基化山梨醇脂肪酸酯和多乙氧基化甘油脂肪酸酯)；其它脱水山梨糖醇衍生物，诸如脱水山梨糖醇酯；聚合物表面活性剂，诸如无规共聚物、嵌段共聚物、醇酸 peg (聚乙二醇)树脂、接枝或梳型聚合物以及星型聚合物；聚乙二醇(peg)；聚乙二醇脂肪酸酯；基于硅氧烷的表面活性剂；和糖衍生物，诸如蔗糖酯、烷基多苷和烷基多糖。

[0596] 有用的阴离子表面活性剂包括但不限于：烷基芳基磺酸及其盐；羧化醇或烷基苯酚乙氧基化物；二苯基磺酸酯衍生物；木质素和木质素衍生物，诸如木质素磺酸盐；马来酸或琥珀酸或它们的酸酐；烯烃磺酸酯；磷酸酯，诸如醇烷氧基化物的磷酸酯、烷基苯酚烷氧基化物的磷酸酯、和苯乙烯基苯酚乙氧基化物的磷酸酯；基于蛋白质的表面活性剂；肌氨酸衍生物；苯乙烯基苯酚醚硫酸盐；油和脂肪酸的硫酸盐和磺酸盐；乙氧基化烷 基苯酚的硫酸盐和磺酸盐；醇的硫酸盐；乙氧基化醇的硫酸盐；胺和酰胺的磺酸盐，诸如N,N-烷基牛磺酸盐；苯、异丙基苯、甲苯、二甲苯以及十二烷基苯和十三烷基苯的磺酸盐；缩聚萘磺酸盐；萘和烷基萘的磺酸盐；石油馏分的磺酸盐；磺基琥珀酰胺酸盐；以及磺基琥珀酸盐和它们的衍生物，诸如二烷基磺基琥珀酸盐。

[0597] 有用的阳离子表面活性剂包括但不限于：酰胺和乙氧基化酰胺；胺诸如N-烷基丙二胺、三亚丙基三胺和二亚丙基四胺，和乙氧基化胺、乙氧基化二胺以及丙氧基化胺(由胺和环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们的混合物制得)；胺盐诸如胺乙酸盐和二胺盐；季铵盐，诸如季盐、乙氧基化季盐和二季盐；以及胺氧化物，诸如烷基二甲基胺氧化物和二-(2-羟基乙基)-烷基胺氧化物。

[0598] 还可用于本发明组合物的是非离子表面活性剂和阴离子表面活性剂的混合物，或非离子表面活性剂和阳离子表面活性剂的混合物。非离子、阴离子和阳离子表面活性剂以及它们被推荐的用途公开于多个已公布的参考文献中，包括由McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 出版的"McCutcheon's Emulsifiers and Detergents"(北美和国际年鉴版)；Sisely 和 Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964 中描述的那些。以及 A.S. Davidson 和 B. Milwidsky 的"Synthetic Detergents"第七版(John Wiley and Sons, New York, 1987)。

[0599] 本发明的组合物还可包含本领域技术人员已知为辅助制剂的制剂助剂和添加剂

(其中一些也可被认为是起到固体稀释剂、液体稀释剂或表面活性剂作用的)。此类制剂助剂和添加剂可参照 :pH (缓冲剂)、加工过程中的泡沫形成(消泡剂诸如聚有机硅氧烷)、活性成分的沉降(悬浮剂)、粘度(触变增稠剂)、容器内的微生物生长(抗微生物剂)、产品冷冻(防冻剂)、颜色(染料 / 颜料分散体)、洗脱(成膜剂或粘合剂)、蒸发(防蒸发剂) 和其它制剂特性。成膜剂包括例如聚乙酸乙烯酯、聚乙酸乙烯酯共聚物、聚乙烯吡咯烷酮 - 乙酸乙烯酯共聚物、聚乙烯醇、聚乙烯醇共聚物和蜡。制剂助剂和添加剂的实例包括由 McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 出 版 的 McCutcheon's Volume2: Functional Materials,北美和国际年鉴版 ;以及 PCT 公开 WO03/024222 中列出的那些。

[0600] 通常通过将活性成分溶于溶剂中或通过在液体或干稀释剂中研磨活性成分来将式 1 的化合物和任何其它活性成分掺入本发明的组合物中。可通过简单地混合所述成分来制备溶液,包括可乳化的浓缩物。如果用作可乳化的浓缩物的液体组合物的溶剂是与水不混溶的,则通常加入乳化剂使含有活性成分的溶剂在用水稀释时发生乳化。可使用介质磨来湿磨粒径为至多 2,000μm 的活性成分浆液,以获得平均直径低于 3μm 的颗粒。水性浆液可以制备为成品悬浮液浓缩物(参见例如 U.S.3,060,084) 或通过喷雾干燥而进一步加工形成水分散性的颗粒。干制剂通常需要干研磨步骤,其产生 2 至 10μm 范围内的平均粒径。粉剂和粉末可以通过混合,并且通常通过研磨(例如用锤磨机或流能磨) 来制备。可通过将活性物质喷雾在预成形颗粒载体上或通过附聚技术来制备颗粒和粒料。参见 Browning 的“Agglomeration”(Chemical Engineering,1967 年 12 月 4 日,第 147-48 页 ; Perry 的 Chemical Engineer's Handbook,第 4 版,McGraw-Hill,New York,1963,第 8-57 页及其后页和 WO91/13546。粒料可以如 U.S.4,172,714 中所述来制备。水分散性和水溶性颗粒可以如 U.S.4,144,050、U.S.3,920,442 和 DE3,246,493 中所教导的来制备。片剂可以如 U.S.5,180,587、U.S.5,232,701 和 U.S.5,208,030 中所提出的来制备。膜剂可根据 GB2,095,558 和 U.S.3,299,566 中的教导制备。

[0601] 关于制剂领域进一步的信息,参见 T.S.Woods 的 Pesticide Chemistry and Bioscience,The Food-Environment Challenge 中的“The Formulator'sToolbox-Product Forms for Modern Agriculture”,T.Brooks 和 T.R.Roberts 编辑,Proceedings of the9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge,1999,第 120-133 页。还参见 U.S.3,235,361,第 6 栏第 16 行至第 7 栏第 19 行和实例 10-41 ;U.S.3,309,192,第 5 栏第 43 行至第 7 栏第 62 行和实例 8、12、15、39、41、52、53、58、132、138-140、162-164、166、167 和 169-182 ;U.S.2,891,855, 第 3 栏 第 66 行至第 5 栏第 17 行和实例 1-4 ;Klingman 的 Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York,1961 年,第 81-96 页 ;Hance 等人的 Weed Control Handbook, 第 八 版, BlackwellScientific Publications, Oxford,1989 ; 以 及 Developments in formulation technology, PJB 出版, Richmond, UK,2000。

[0602] 在以下实例中,全部百分比都是按重量计的,所有的制剂以常规的方式制备。化合物编号参照索引表 A 中的化合物。无需进一步发挥,据信采用上文描述的本领域的技术人员可最大限度地利用本发明。因此以下实例应理解为仅是举例说明,而不以任何方式限制本发明的公开内容。百分比为按重量计,除非另外说明。

[0603] 实例 A

[0604] 高强度浓缩物

[0605]

化合物 47	49.3%
吡噻菌胺	49.2%
二氧化硅气凝胶	0.5%
合成的非晶形精细二氧化硅	1.0%

[0606] 实例 B

[0607] 可润湿的粉末

[0608]

化合物 81	43.0%
快诺芬	22.0%
十二烷基苯酚聚乙二醇醚	2.0%
木质素磺酸钠	4.0%
硅酸铝钠	6.0%
蒙脱石（煅烧）	23.0%

[0609] 实例 C

[0610] 颗粒

[0611]

化合物 136	7.5%
氟环唑	2.5%
绿坡缕石颗粒（低挥发性物质、0.71/0.30mm；U.S.S. No. 25-50 筛）	90.0%

[0612] 实例 D

[0613] 挤出粒料

[0614]

化合物 144	8.0%
螺环菌胺	17.0%
无水硫酸钠	10.0%
粗木质素磺酸钙	5.0%
烷基萘磺酸钠	1.0%
钙/镁膨润土	59.0%

[0615] 实例 E

[0616] 可乳化的浓缩物

[0617]

化合物 161	5.0%
嘧菌酯	5.0%
聚氧乙烯山梨醇六油酸酯	20.0%
C_6-C_{10}脂肪酸甲酯	70.0%

[0618] 实例 F

[0619] 微乳液

[0620]

化合物 195	3.3%
啶氧菌酯	1.7%
聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯酯共聚物	30.0%
烷基多苷	30.0%
油酸单甘油酯	15.0%
水	20.0%

[0621] 实例 G

[0622] 种子处理剂

[0623]

化合物 238	4.00%
异菌脲	16.00%
聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯酯共聚物	5.00%
褐煤酸蜡	5.00%
木质素磺酸钙	1.00%
聚氧乙烯/聚氧丙烯嵌段共聚物	1.00%
硬脂醇（POE 20）	2.00%
聚有机硅	0.20%

[0624] 着色剂红色染料 0.05%

[0625] 水 65.75%

[0626] 实例 H

[0627] 可乳化的浓缩物

[0628] 化合物 239 10.0%

[0629] 聚氧乙烯山梨醇六油酸酯 20.0%

[0630] C_6-C_{10} 脂肪酸甲酯 70.0%

[0631] 通常用水稀释制剂，如制剂表中的那些，以在施用前形成含水组合物。直接应用于植物或其部分的含水组合物（例如喷雾罐组合物）通常包含至少约 1ppm 或更多（例如 1ppm 至 100ppm）的根据本发明的杀真菌活性化合物。

[0632] 组分 (b) 杀真菌化合物的实例包括苯并噻二唑 -S- 甲基、4- 十二烷基 -2,6- 二甲基吗啉 (aldimorph)、辛唑嘧菌胺 (ametoctradin)、吲唑磺菌胺、敌菌灵、戊环唑、嘧菌酯、苯霜灵、苯霜灵 -M、麦锈灵、苯菌灵、苯噻菌胺、异丙基苯噻菌胺、3- 苯并 [b] 噻吩 -2- 基 -5,6- 二氢 -1,4,2- 噁噻嗪 4- 氧化物 (bethoxazin)、乐杀螨、联苯、双苯三唑醇、联苯吡菌胺 (bixafen)、杀稻瘟菌素 -S、啶酰菌胺、糠菌唑、乙嘧酚磺酸酯、丁赛特、萎锈灵、环丙酰菌胺、敌菌丹、克菌丹、多菌灵、地茂散、百菌清、乙菌利、克霉唑、铜盐，如波尔多液（三元硫酸铜）、氢氧化铜和王铜、赛座灭、环氟菌胺、霜脲氰、环丙唑醇、嘧菌环胺、抑菌灵、双氯氰菌胺、哒菌清、氯硝胺、乙霉威、恶醚唑、二氟林、甲菌定、烯酰吗啉、醚菌胺、烯唑醇、烯唑醇 -M、敌螨普、二噻农、十二环吗啉、多果定、敌瘟磷、烯肟菌酯、氟环唑、乙环唑、噻唑菌胺、乙嘧酚、土菌灵、[illegible]唑菌酮、咪唑菌酮、氯苯嘧啶醇、腈苯唑、甲呋酰苯胺、环酰菌胺、氰菌胺、拌种咯、苯锈啶、丁苯吗啉、胺苯吡菌酮、三苯基乙酸锡、三苯基氯化锡、三苯基氢氧化锡、福美铁、嘧菌腙、氟啶胺、咯菌腈、氟酰菌胺、氟吗啉、氟吡菌胺（也已

知为氟啶酰菌胺）、氟吡菌酰胺、氟酰亚胺、氟嘧菌酯、氟喹唑、氟硅唑、磺菌胺、氟噻菌净(2-[[2-氟-5-(三氟甲基)苯基]硫]-2-[3-(2-甲氧苯基)-2-亚噻唑烷基]乙腈)、氟酰胺、粉唑醇、氟苯吡 菌胺(fluxapyroxad)、灭菌丹、三乙膦酸铝、麦穗宁、呋霜灵、福拉比、己唑醇、恶霉灵、克热净、抑霉唑、酰胺唑、双胍辛胺、碘代丙炔基丁基氨基甲酸酯(iodocarb)、种菌唑、异稻瘟净、异菌脲、丙森锌、稻瘟灵、萘吡菌胺(isopyrazam)、异噻菌胺、春雷霉素、克收欣、代森锰锌、双炔酰菌胺、代森锰、灭锈胺、消螨普、甲霜灵、甲霜灵-M、叶菌唑、磺菌威、代森联、苯氧菌胺、嘧菌胺、苯菌酮、腈菌唑、奈替芬、甲肿铁铵(甲基肿酸铁)、氟苯嘧啶醇、辛噻酮、呋酰胺、肟醚菌胺、恶霜灵、[illegible]喹酸、[illegible]咪唑、氧化萎锈灵、氧四环素、戊菌唑、戊菌隆、戊苯吡菌胺、吡噻菌胺、稻瘟酯、亚磷酸及其盐、苯酞、啶氧菌酯、粉病灵、多抗霉素、烯丙异噻唑、咪鲜安、腐霉利、霜霉威、霜霉威盐酸盐、丙环唑、丙森锌、丙氧喹啉、丙硫菌唑、唑菌胺酯、唑胺菌酯、唑菌酯、定菌磷、吡菌苯威(pyribencarb)、稗草畏、啶斑肟、嘧霉胺、甲氧苯啶菌(pyriofenone)、咯喹酮、硝吡咯菌素、喹唑、灭螨猛、快诺芬、五氯硝基苯、环丙吡菌胺(sedaxane)、硅噻菌胺、硅氟唑、螺环菌胺、链霉素、硫、戊唑醇、异丁乙氧喹啉(tebufloquin)、克枯烂、四氯硝基苯、特比萘芬、氟醚唑、噻菌灵、噻呋灭、托布津、甲基硫菌灵、二硫四甲秋兰姆、噻酰菌胺、甲基立枯磷、对甲抑菌灵、三唑酮、三唑醇、嘧菌醇、唑菌嗪、三环唑、十三吗啉、氟菌唑、三环唑、肟菌酯、嗪氨灵、垂吗酰胺、灭菌唑、烯效唑、井冈霉素、霜霉灭(霜霉灭)、乙烯菌核利、代森锌、福美锌、苯酰菌胺(zoxamide)，N'-[4-[4-氯-3-(三氟甲基)苯氧基]-2,5-二甲基苯基]-N-乙基-N-甲基甲亚胺酰胺、5-氯-6-(2,4,6-三氟苯基)-7-(4-甲基哌啶-1-基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶(BAS600)、N-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧]-3-甲氧苯基]乙基]-3-甲基-2-[(甲磺酰)氨基]丁酰胺、N-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧]-3-甲氧苯基]乙基]-3-甲基-2-[(乙基磺酰基)氨基]丁酰胺、2-丁氧基-6-碘代-3-丙基-4H-1-苯并吡喃-4-酮、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基-3-异[illegible]唑啉基]吡啶、N-[1-[[[1-(4-氰基苯基)乙基]磺酰基]甲基]丙基]氨基甲酸-4-氟苯酯、N-[[(环丙基甲氧基)氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]亚甲基]苯乙酰胺、α-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-2-[[[1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基]亚氨基]甲基]苯乙酰胺、N'-[4-[4-氯-3-(三氟甲基)苯氧基]-2,5-二甲基苯基]-N-乙基-N-甲基甲亚胺 酰胺、N-(4-氯-2-硝基苯基)-N-乙基-4-甲基苯磺酰胺、2-[[[[3-(2,6-二氯苯基)-1-甲基-2-丙烯-1-亚基]氨基]氧]甲基]-α-(甲氧基亚氨基)-N-甲基苯乙酰胺、1-[(2-丙烯硫基)羰基]-2-(1-甲基乙基)-4-(2-甲基苯基)-5-氨基-1H-吡唑-3-酮、乙基-6-辛基-[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-7-基胺、N-[4-[[[[(1-甲基-1H-四唑-5-基)苯基亚甲基]氨基]氧]甲基]-2-噻唑基]氨基甲酸戊酯、N-[6-[[[[(1-甲基-1H-四唑-5-基)苯基亚甲基]氨基]氧]甲基]-2-吡啶基]氨基甲酸戊酯、2-[(3-溴-6-喹啉基)氧]-N-(1,1-二甲基-2-丁炔-1-基)-2-(甲硫基)乙酰胺、2-[(3-乙炔基-6-喹啉基)氧]-N-[1-(羟甲基)-1-甲基-2-丙炔-1-基]-2-(甲硫基)乙酰胺、N-(1,1-二甲基-2-丁炔-1-基)-2-[(3-乙炔基-6-喹啉基)氧]-2-(甲硫基)乙酰胺和N'-[4-[[3-[(4-氯苯基)甲基]-1,2,4-噻二唑-5-基]氧]-2,5-二甲基苯基]-N-乙基-N-甲基甲亚胺酰胺。值得注意的是，前述清单还不包括N'-[4-[[3-[(4-氯苯基)甲基]-1,2,4-噻二唑-5-基]氧]-2,5-二甲基苯基]-N-乙基-N-甲基甲亚胺酰胺。还值得注意的是，前述清单还不包括丁赛特、乙环唑、喹

唑、嘧菌醇、2-[(3-溴-6-喹啉基)氧]-N-(1,1-二甲基-2-丁炔-1-基)-2-(甲硫基)乙酰胺、2-[(3-乙炔基-6-喹啉基)氧]-N-[1-(羟甲基)-1-甲基-2-丙炔-1-基]-2-(甲硫基)乙酰胺和N-(1,1-二甲基-2-丁炔-1-基)-2-[(3-乙炔基-6-喹啉基)氧]-2-(甲硫基)乙酰胺。

[0633] 值得注意的是，作为在本发明的组合物组分(b)中的杀真菌化合物为嘧菌酯、克收欣、肟菌酯、唑菌胺酯、唑胺菌酯、唑菌酯、啶氧菌酯、醚菌胺、苯氧菌胺/苯氧菌胺、多菌灵、百菌清、快诺芬、苯菌酮、甲氧苯啶菌(pyriofenone)、环氟菌胺、苯锈啶、丁苯吗啉、糠菌唑、环丙唑醇、恶醚唑、氟环唑、乙环唑、腈苯唑、氟硅唑、氟苯吡菌胺(fluxapyroxad)、己唑醇、种菌唑、叶菌唑、腈菌唑、戊菌唑、丙环唑、丙氧喹啉、丙硫菌唑、戊唑醇、灭菌唑、[illegible]唑菌酮、咪鲜安、吡噻菌胺和啶酰菌胺(啶酰菌胺)。

[0634] 一般对于更好的控制由植物病原真菌引起的植物病害(如较低的使用率或更宽的植物病原体控制范围)或抗性管理优选的为式1的化合物、其N-氧化物或其盐的混合物，其具有选自以下组的杀真菌化合物：嘧菌酯、克收欣、肟菌酯、唑菌胺酯、唑胺菌酯、唑菌酯、啶氧菌酯、醚菌胺、苯氧菌胺/苯氧菌胺、快诺芬、苯菌酮、环氟菌胺、苯锈啶、丁苯吗啉、环丙唑醇、恶醚唑、氟环唑、乙环唑、氟硅唑、叶菌唑、腈菌唑、丙环唑、丙 氧喹啉、丙硫菌唑、甲氧苯啶菌(pyriofenone)、戊唑醇、灭菌唑、[illegible]唑菌酮和吡噻菌胺。

[0635] 在本发明杀真菌组合物中，组分(a)(即，至少一种化合物选自式1的化合物、其N-氧化物及其盐)和组分(b)以杀真菌有效量存在。组分(b)(即，一个或多个附加的杀真菌化合物)与组分(a)的重量比一般介于约1:3000至约3000:1之间，并且更典型介于约1:500和约500:1之间。表B1列出了涉及组分(b)具体杀真菌化合物典型的、更典型的和最典型的比率范围。表A1至A43和C1至C43举例说明了对于杀真菌化合物的具体组合的重量比。值得注意的是其中组分(a)与组分(b)的重量比为约125:1至约1:125的组合物。具有许多组分(b)的杀真菌化合物，这些组合物尤其有效用于控制由真菌植物病原体引起的植物病害。尤其值得注意的是其中组分(a)与组分(b)的重量比为约25:1至约1:25，或约5:1至约1:5的组合物。本领域的技术员通过简单的实验可容易地确定对于杀真菌保护和控制所期望的范围的必须的杀真菌化合物的重量比和施用量。将显而易见的是，在组分(b)中包括附加的杀真菌化合物可扩大所控制的植物病害范围超越由单独组分(a)所控制的范围。

[0636] 具体的混合物(化合物编号涉及在索引表A中的化合物)列于表A1至A43中。在表A1中，在栏标题“组分(a)”和“组分(b)”下面的每行具体地公开了为化合物3组分(a)混合物，所述组合物具有组分(b)的杀真菌化合物。在标题“例证性比率”下的条目公开了关于公开的混合物的组分(b)与组分(a)三个具体的重量比。例如，表A1的第一行公开了化合物3与阿拉酸式苯-S-甲基的混合物，并列出阿拉酸式苯-S-甲基与化合物3的1:1、1:4或1:18的重量比。

[0637] 表A1

[0638]

组分（a）	组分（b）	例证性比率（*）		
化合物 3	阿拉酸式苯-S-甲基	1:1	1:4	1:18
化合物 3	杀螟丹	7:1	3:1	1:1
化合物 3	辛唑嘧菌胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	吲唑磺菌胺	1:1	1:2	1:6
化合物 3	敌菌灵	22:1	8:1	4:1
化合物 3	戊环唑	2:1	1:2	1:4

[0639]

组分（a）	组分（b）	例证性比率（*）		
化合物 3	嘧菌酯	3:1	1:1	1:3
化合物 3	苯霜灵	1:1	1:2	1:6
化合物 3	苯霜灵-M	1:1	1:3	1:8
化合物 3	麦锈灵	4:1	2:1	1:2
化合物 3	苯菌灵	11:1	4:1	1:1
化合物 3	苯噻菌胺	1:1	1:4	1:12
化合物 3	异丙基苯噻菌胺	1:1	1:4	1:12
化合物 3	哒菌酮	15:1	5:1	2:1
化合物 3	乐杀螨	15:1	5:1	2:1
化合物 3	联苯	15:1	5:1	2:1
化合物 3	双苯三唑醇	3:1	1:1	1:2
化合物 3	广谱杀菌剂	2:1	1:1	1:3
化合物 3	杀稻瘟菌素-S	1:4	1:12	1:30
化合物 3	波尔多液（三元硫酸铜）	45:1	15:1	5:1
化合物 3	啶酰菌胺	4:1	2:1	1:2
化合物 3	糠菌唑	3:1	1:1	1:3
化合物 3	乙嘧酚磺酸酯	1:3	1:10	1:30
化合物 3	敌菌丹	15:1	5:1	2:1
化合物 3	克菌丹	15:1	5:1	2:1
化合物 3	多菌灵	11:1	4:1	2:1
化合物 3	萎锈灵	4:1	2:1	1:2
化合物 3	环丙酰菌胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	地茂散	100:1	35:1	14:1
化合物 3	百菌清	15:1	5:1	2:1
化合物 3	乙菌利	11:1	4:1	2:1
化合物 3	克霉唑	3:1	1:1	1:3
化合物 3	氢氧化铜	45:1	15:1	5:1
化合物 3	王铜	45:1	15:1	5:1
化合物 3	赛座灭	1:1	1:2	1:6
化合物 3	环氟菌胺	1:2	1:6	1:24
化合物 3	霜脲氰	1:1	1:2	1:5
化合物 3	环丙唑醇	1:1	1:2	1:6
化合物 3	嘧菌环胺	4:1	2:1	1:2
化合物 3	抑菌灵	15:1	5:1	2:1
化合物 3	双氯氰菌胺	15:1	5:1	2:1
化合物 3	哒菌清	3:1	1:1	1:3
化合物 3	氯硝胺	15:1	5:1	2:1
化合物 3	乙霉威	7:1	2:1	1:2
化合物 3	恶醚唑	1:1	1:3	1:12
化合物 3	二氯林	15:1	5:1	2:1
化合物 3	甲菌定	1:3	1:8	1:30

[0640]

组分（a）	组分（b）	例证性比率（*）		
化合物 3	烯酰吗啉	3:1	1:1	1:2
化合物 3	醚菌胺	2:1	1:1	1:4
化合物 3	烯唑醇	1:1	1:3	1:8
化合物 3	烯唑醇-M	1:1	1:3	1:12
化合物 3	敌螨普	2:1	1:1	1:3
化合物 3	二噻农	5:1	2:1	1:2
化合物 3	十二环吗啉	7:1	3:1	1:1
化合物 3	多果定	10:1	4:1	2:1
化合物 3	敌瘟磷	3:1	1:1	1:3
化合物 3	烯肟菌酯	2:1	1:1	1:4
化合物 3	氟环唑	1:1	1:3	1:7
化合物 3	乙环唑	1:1	1:3	1:7
化合物 3	噻唑菌胺	2:1	1:1	1:3
化合物 3	乙嘧酚	7:1	3:1	1:1
化合物 3	土菌灵	7:1	2:1	1:2
化合物 3	噁唑菌酮	2:1	1:1	1:4
化合物 3	咪唑菌酮	2:1	1:1	1:4
化合物 3	氯苯嘧啶醇	1:2	1:7	1:24
化合物 3	腈苯唑	1:1	1:3	1:10
化合物 3	甲呋酰苯胺	4:1	1:1	1:2
化合物 3	环酰菌胺	10:1	4:1	2:1
化合物 3	氟菌胺	15:1	4:1	1:1
化合物 3	拌种咯	15:1	5:1	2:1
化合物 3	苯锈啶	7:1	2:1	1:1
化合物 3	丁苯吗啉	7:1	2:1	1:1
化合物 3	胺苯吡菌酮（fenpyrazamine）	3:1	1:1	1:3
化合物 3	三苯基锡盐、如三苯基乙酸锡、三苯基氯化锡或三苯基氢氧化锡	3:1	1:1	1:3
化合物 3	福美铁	30:1	10:1	4:1
化合物 3	嘧菌腙	7:1	2:1	1:2
化合物 3	氟啶胺	3:1	1:1	1:2
化合物 3	咯菌腈	2:1	1:1	1:4
化合物 3	氟酰菌胺	3:1	1:1	1:2
化合物 3	氟吗啉	3:1	1:1	1:3
化合物 3	氟吡菌胺	1:1	1:2	1:6
化合物 3	氟吡菌酰胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	氟酰亚胺	37:1	14:1	5:1
化合物 3	氟嘧菌酯	1:1	1:2	1:6
化合物 3	氟喹唑	1:1	1:2	1:4
化合物 3	氟硅唑	3:1	1:1	1:3
化合物 3	磺菌胺	15:1	5:1	2:1

[0641]

组分（a）	组分（b）	例证性比率（*）		
化合物 3	氟噻菌净	1:1	1:2	1:6
化合物 3	氟酰胺	4:1	1:1	1:2
化合物 3	粉唑醇	1:1	1:2	1:4
化合物 3	氟苯吡菌胺（fluxapyroxad）	2:1	1:1	1:3
化合物 3	灭菌丹	15:1	5:1	2:1
化合物 3	三乙膦酸铝	30:1	12:1	5:1
化合物 3	麦穗宁	11:1	4:1	2:1
化合物 3	呋霜灵	1:1	1:2	1:6
化合物 3	福拉比	15:1	5:1	2:1
化合物 3	克热净	15:1	5:1	2:1
化合物 3	己唑醇	1:1	1:2	1:5
化合物 3	恶霉灵	75:1	25:1	9:1
化合物 3	抑霉唑	1:1	1:2	1:5
化合物 3	酰胺唑	1:1	1:2	1:5
化合物 3	双胍辛胺	15:1	4:1	1:1
化合物 3	碘代丙炔基丁基甲氨酸酯	15:1	5:1	2:1
化合物 3	种菌唑	1:1	1:2	1:5
化合物 3	异稻瘟净	15:1	5:1	2:1
化合物 3	异菌脲	15:1	5:1	2:1
化合物 3	丙森锌	2:1	1:1	1:3
化合物 3	稻瘟灵	45:1	15:1	5:1
化合物 3	萘吡菌胺（isopyrazam）	2:1	1:1	1:3
化合物 3	异噻菌胺	2:1	1:1	1:3
化合物 3	春雷霉素	1:2	1:7	1:24
化合物 3	克收欣	2:1	1:1	1:4
化合物 3	代森锰锌	22:1	7:1	3:1
化合物 3	双炔酰菌胺	2:1	1:1	1:4
化合物 3	代森锰	22:1	7:1	3:1
化合物 3	灭派林	6:1	2:1	1:1
化合物 3	灭锈胺	1:1	1:2	1:6
化合物 3	消螨普	2:1	1:1	1:3
化合物 3	甲霜灵	1:1	1:2	1:6
化合物 3	甲霜灵-M	1:1	1:4	1:12
化合物 3	叶菌唑	1:1	1:2	1:6
化合物 3	磺菌威	15:1	5:1	2:1
化合物 3	代森联	15:1	5:1	2:1
化合物 3	苯氧菌胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	苯菌酮	2:1	1:1	1:4
化合物 3	腈菌唑	1:1	1:3	1:8
化合物 3	奈替芬	15:1	5:1	2:1
化合物 3	新阿苏仁（甲基肿酸铁）	15:1	5:1	2:1

[0642]

组分（a）	组分（b）	例证性比率（*）		
化合物 3	氟苯嘧啶醇	3:1	1:1	1:3
化合物 3	辛噻酮	15:1	4:1	1:1
化合物 3	呋酰胺	1:1	1:2	1:6
化合物 3	肟醚菌胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	恶霜灵	1:1	1:2	1:6
化合物 3	噁唑酸	7:1	2:1	1:2
化合物 3	噁咪唑	1:1	1:2	1:5
化合物 3	氧化萎锈灵	4:1	1:1	1:2
化合物 3	氧四环素	3:1	1:1	1:3
化合物 3	稻瘟酯	15:1	5:1	2:1
化合物 3	戊菌唑	1:2	1:6	1:15
化合物 3	戊菌隆	11:1	4:1	2:1
化合物 3	戊苯吡菌胺	2:1	1:1	1:3
化合物 3	吡噻菌胺	2:1	1:1	1:3
化合物 3	亚磷酸或其盐	15:1	6:1	2:1
化合物 3	苯酞	15:1	6:1	2:1
化合物 3	啶氧菌酯	1:1	1:2	1:5
化合物 3	粉病灵	3:1	1:1	1:3
化合物 3	多抗霉素	3:1	1:1	1:3
化合物 3	烯丙异噻唑	3:1	1:1	1:3
化合物 3	咪鲜安	7:1	2:1	1:2
化合物 3	腐霉利	11:1	4:1	2:1
化合物 3	霜霉威或霜霉威-盐酸盐	10:1	4:1	2:1
化合物 3	丙环唑	1:1	1:2	1:5
化合物 3	丙森锌	11:1	4:1	2:1
化合物 3	丙氧喹啉	1:1	1:3	1:12
化合物 3	硫菌威	3:1	1:1	1:3
化合物 3	丙硫菌唑	1:1	1:2	1:5
化合物 3	吡菌胺酯	2:1	1:1	1:4
化合物 3	吡胺菌酯	2:1	1:1	1:4
化合物 3	吡菌酯	2:1	1:1	1:4
化合物 3	定菌磷	15:1	4:1	1:1
化合物 3	吡菌苯威（pyribencarb）	4:1	1:1	1:2
化合物 3	稗草畏	15:1	4:1	1:1
化合物 3	啶斑肟	3:1	1:1	1:3
化合物 3	嘧霉胺	3:1	1:1	1:2
化合物 3	甲氧苯啶菌（pyriofenone）	2:1	1:1	1:4
化合物 3	咯喹酮	3:1	1:1	1:3
化合物 3	硝吡咯菌素	15:1	5:1	2:1
化合物 3	喹唑	1:1	1:2	1:4
化合物 3	灭螨猛	15:1	5:1	2:1

[0643]

组分（a）	组分（b）	例证性比率（*）		
化合物 3	呋诺芬	1:1	1:2	1:6
化合物 3	五氯硝基苯	15:1	5:1	2:1
化合物 3	硅噻菌胺	2:1	1:1	1:4
化合物 3	硅氟唑	1:1	1:2	1:5
化合物 3	螺环菌胺	5:1	2:1	1:2
化合物 3	链霉素	3:1	1:1	1:3
化合物 3	硫	75:1	25:1	9:1
化合物 3	戊唑醇	1:1	1:2	1:5
化合物 3	异丁乙氧喹啉（tebufloquin）	3:1	1:1	1:3
化合物 3	克枯烂	15:1	5:1	2:1
化合物 3	四氯硝基苯	15:1	5:1	2:1
化合物 3	特比萘芬	15:1	5:1	2:1
化合物 3	氟酰唑	1:1	1:2	1:5
化合物 3	噻菌灵	11:1	4:1	2:1
化合物 3	噻呋灭	3:1	1:1	1:3
化合物 3	托布津	11:1	4:1	2:1
化合物 3	甲基硫菌灵	11:1	4:1	2:1
化合物 3	二硫四甲秋兰姆	37:1	14:1	5:1
化合物 3	噻酰菌胺	2:1	1:1	1:3
化合物 3	甲基立枯磷	37:1	14:1	5:1
化合物 3	甲苯氟磺胺	15:1	5:1	2:1
化合物 3	三唑酮	1:1	1:2	1:5
化合物 3	三唑醇	1:1	1:2	1:5
化合物 3	嘧菌醇	1:2	1:7	1:24
化合物 3	唑菌嗪	15:1	5:1	2:1
化合物 3	三环唑	3:1	1:1	1:3
化合物 3	十三吗啉	7:1	2:1	1:1
化合物 3	肟菌酯	2:1	1:1	1:4
化合物 3	氟菌唑	3:1	1:1	1:3
化合物 3	嗪氨灵	3:1	1:1	1:3
化合物 3	垂吗酰胺	7:1	2:1	1:2
化合物 3	灭菌唑	1:1	1:2	1:5
化合物 3	烯效唑	1:1	1:2	1:5
化合物 3	井冈霉素	3:1	1:1	1:3
化合物 3	霜霉灭	2:1	1:1	1:4
化合物 3	乙烯菌核利	15:1	6:1	2:1
化合物 3	代森锌	37:1	14:1	5:1
化合物 3	福美锌	37:1	14:1	5:1
化合物 3	草酰胺	2:1	1:1	1:4
化合物 3	5-氯-6-（2,4,6-三氟苯基）-7-（4-甲基哌啶-1-基）[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶	1:1	1:2	1:6

[0644]

组分（a）	组分（b）	例证性比率（*）		
化合物 3	*N*-[2-[4-[[3-（4-氯苯基）-2-丙炔-1-基]氧代]-3-甲氧基苯基]乙基]-3-甲基-2-[（甲基磺酰基）氨基]丁酰胺	2:1	1:1	1:4
化合物 3	*N*-[2-[4-[[3-（4-氯苯基）-2-丙炔-1-基]氧代]-3-甲氧基苯基]乙基]-3-甲基-2-[（乙磺酰基）氨基]丁酰胺	2:1	1:1	1:4
化合物 3	2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4*H*-1-苯并吡喃-4-酮	1:1	1:3	1:12
化合物 3	3-[5-（4-氯苯基）-2,3-二甲基-3-异噁唑烷基]吡啶	3:1	1:1	1:3
化合物 3	*N'*-[4-[[3-[（4-氯苯基）甲基]-1,2,4-噻二唑-5-基]氧]-2,5-二甲基苯基]-*N*-乙基-*N*-甲基甲亚胺酰胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	*N*-[1-[[[1-（4-氯基苯基）乙基]磺酰基]甲基]丙基]氨基甲酸 4-氯苯酯	2:1	1:1	1:4
化合物 3	*N*-[[（环丙基甲氧基）氨基][6-（二氟甲氧基）-2,3-二氟苯基]亚甲基]苯乙酰胺	1:2	1:7	1:24
化合物 3	α-[甲氧基亚氨基]-N-甲基-2-[[[1-[3-（三氟甲基）苯基]乙氧基]亚氨基]甲基]苯乙酰胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	*N'*-[4-[4-氯-3-（三氟甲基）苯氧基]-2,5-二甲基苯基]-*N*-乙基-*N*-甲基甲亚胺酰胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	*N*-（4-氯-2-硝基苯基）-*N*-乙基-4-甲基苯磺酰胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	2-[[[3-（2,6-二氯苯基）-1-甲基-2-丙烯-1-亚基]氨基]氧]甲基]-α-（甲氧基亚氨基）-N-甲基苯乙酰胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	N-/4-[[[[（1-甲基-1*H*-四唑-5-基）苯基亚甲基]氨基]氧]甲基]-2-噻唑基]氨基甲酸戊酯	3:1	1:1	1:3
化合物 3	N-/6-[[[[（1-甲基-1*H*-四唑-5-基）苯基亚甲基]氨基]氧]甲基]-2-吡啶基]氨基甲酸戊酯	3:1	1:1	1:3
化合物 3	2-[（3-溴-6-喹啉基）氧]-*N*-（1,1-二甲基-2-丁炔-1-基）-2-（甲硫基）乙酰胺	2:1	1:1	1:4
化合物 3	2-[（3-乙炔基-6-喹啉基）氧]-*N*-[1-（羟甲基）-1-甲基-2-丙炔-1-基]-2-（甲硫基）乙酰胺	2:1	1:1	1:4
化合物 3	*N*-（1,1-二甲基-2-丁炔-1-基）-2-[（3-乙炔基-6-喹啉基）氧]-2-（甲硫基）乙酰胺	2:1	1:1	1:4

[0645] （*）组分（b）相对于组分（a）的重量比

[0646] 表 A2 至 A43 每个构造与上表 A1 中相同，不同的是栏标题下面的条目“组分（a）”被下文所示的相应组分（a）的栏条目替代。因此，例如，表 A2 中栏标题下面的条目“组分（a）”全列举为“化合物 7”，并且表 A2 中栏标题下面的第一行具体公开了化合物 7 与阿拉酸式苯 -S- 甲基的混合物。表 A3 至 A43 类似地构造。

[0647]

表编号	组分（a）栏条目	表编号	组分（a）栏条目
A2	化合物 7	A23	化合物 252
A3	化合物 8	A24	化合物 253
A4	化合物 13	A25	化合物 254
A5	化合物 17	A26	化合物 257
A6	化合物 40	A27	化合物 258
A7	化合物 47	A28	化合物 259
A8	化合物 81	A29	化合物 260
A9	化合物 82	A30	化合物 261
A10	化合物 122	A31	化合物 262
A11	化合物 136	A32	化合物 263
A12	化合物 143	A33	化合物 264
A13	化合物 144	A34	化合物 265
A14	化合物 161	A35	化合物 266
A15	化合物 195	A36	化合物 267
A16	化合物 238	A37	化合物 268
A17	化合物 239	A38	化合物 269
A18	化合物 240	A39	化合物 270
A19	化合物 241	A40	化合物 271
A20	化合物 244	A41	化合物 273
A21	化合物 245	A42	化合物 275
A22	化合物 247	A43	化合物 276

[0648] 表 B1 列出了组分(b)化合物与组分(a)的具体组合，例证了本发明的混合物、组合物和方法。表 B1 的第一栏列出了具体的组分(b)化合物(例如第一行的“阿拉酸式苯 -S- 甲基”)。表 B1 的第二、第三和第四栏列出了组分(b)化合物通常施用于农田生长的农作物的量相对于组分(a)的重量比范围(如阿拉酸式苯 -S- 甲基相对于组分(a)为按重量计“2:1 至 1:180”)。因此，例如表 B1 的第一行所具体公开，通常以介于 2:1 至 1:180 之间的重量比施用阿拉酸式苯 -S- 甲基与组分(a)的组合。表 B1 的其余行可类似地解释。尤其值得注意的是包含在实施例 45 中作为组分(a)所列出的化合物中任一项与根据在表 B1 中所公开的重量比在表 B1 组分(b)栏中所列化合物的混合物的组合物。因此，表 B1 补充了公开于具有关于这些组合的比率范围的表 A1 至 A43 的具体比率。

[0649] 表 B1

[0650]

组分（b）	典型的重量比	更典型的重量比	最典型的重量比
阿拉酸式苯-S-甲基	2:1 至 1:180	1:1 至 1:60	1:1 至 1:18
杀螟丹	30:1 至 1:3	10:1 至 1:1	7:1 至 1:1
辛唑嘧菌胺	9:1 至 1:18	3:1 至 1:6	3:1 至 1:3
吲唑磺菌胺	6:1 至 1:18	2:1 至 1:6	1:1 至 1:6
敌菌灵	90:1 至 2:1	30:1 至 4:1	22:1 至 4:1
戊环唑	7:1 至 1:18	2:1 至 1:6	2:1 至 1:4
嘧菌酯	9:1 至 1:12	3:1 至 1:4	3:1 至 1:3
苯霜灵	4:1 至 1:18	1:1 至 1:6	1:1 至 1:6
苯霜灵-M	4:1 至 1:36	1:1 至 1:12	1:1 至 1:8
麦锈灵	18:1 至 1:6	6:1 至 1:2	4:1 至 1:2
苯菌灵	45:1 至 1:4	15:1 至 1:1	11:1 至 1:1
苯噻菌胺或异丙基苯噻菌胺	2:1 至 1:36	1:1 至 1:12	1:1 至 1:12
哒菌酮	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
乐杀螨	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
联苯	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
双苯三唑醇	15:1 至 1:5	5:1 至 1:2	3:1 至 1:2
广谱杀菌剂	12:1 至 1:9	4:1 至 1:3	2:1 至 1:3
杀稻瘟菌素-S	3:1 至 1:90	1:1 至 1:30	1:4 至 1:30
啶酰菌胺	18:1 至 1:6	6:1 至 1:2	4:1 至 1:2
糠菌唑	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3
乙嘧酚磺酸酯	3:1 至 1:90	1:1 至 1:30	1:3 至 1:30
敌菌丹	90:1 至 1:4	30:1 至 1:2	15:1 至 2:1
克菌丹	90:1 至 1:4	30:1 至 1:2	15:1 至 2:1
多菌灵	45:1 至 1:4	15:1 至 1:2	11:1 至 2:1
萎锈灵	18:1 至 1:6	6:1 至 1:2	4:1 至 1:2
环丙酰菌胺	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3
地茂散	300:1 至 2:1	100:1 至 4:1	100:1 至 14:1
百菌清	90:1 至 1:4	30:1 至 1:2	15:1 至 2:1
乙菌利	45:1 至 1:2	15:1 至 2:1	11:1 至 2:1
克霉唑	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3
铜盐，如波尔多液（三元硫酸铜）、王铜、硫酸铜和氢氧化铜	450:1 至 1:1	150:1 至 4:1	45:1 至 5:1
赛座灭	4:1 至 1:18	1:1 至 1:6	1:1 至 1:6
环氟菌胺	1:1 至 1:90	1:2 至 1:30	1:2 至 1:24

[0651]

组分（b）	典型的重量比	更典型的重量比	最典型的重量比
霜脲氰	6:1 至 1:18	2:1 至 1:6	1:1 至 1:5
环丙唑醇	4:1 至 1:18	1:1 至 1:6	1:1 至 1:6
嘧菌环胺	22:1 至 1:9	7:1 至 1:3	4:1 至 1:2
抑菌灵	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
双氯氰菌胺	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
哒菌清	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3
氯硝胺	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
乙霉威	22:1 至 1:9	7:1 至 1:3	7:1 至 1:2
恶醚唑	4:1 至 1:36	1:1 至 1:12	1:1 至 1:12
二氯林	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
甲菌定	3:1 至 1:90	1:1 至 1:30	1:3 至 1:30
烯酰吗啉	9:1 至 1:6	3:1 至 1:2	3:1 至 1:2
醚菌胺	9:1 至 1:18	3:1 至 1:6	2:1 至 1:4
烯唑醇	3:1 至 1:36	1:1 至 1:12	1:1 至 1:8
烯唑醇 M	3:1 至 1:90	1:1 至 1:30	1:1 至 1:12
敌螨普	7:1 至 1:9	2:1 至 1:3	2:1 至 1:3
二噻农	15:1 至 1:4	5:1 至 1:2	5:1 至 1:2
十二环吗啉	30:1 至 1:3	10:1 至 1:1	7:1 至 1:1
多果定	30:1 至 1:2	10:1 至 2:1	10:1 至 2:1
敌瘟磷	30:1 至 1:9	10:1 至 1:3	3:1 至 1:3
烯肟菌酯	9:1 至 1:18	3:1 至 1:6	2:1 至 1:4
氟环唑	3:1 至 1:36	1:1 至 1:12	1:1 至 1:7
乙环唑	3:1 至 1:36	1:1 至 1:12	1:1 至 1:7
噻唑菌胺	7:1 至 1:9	2:1 至 1:3	2:1 至 1:3
乙嘧酚	30:1 至 1:3	10:1 至 1:1	7:1 至 1:1
土菌灵	30:1 至 1:9	10:1 至 1:3	7:1 至 1:2
噁唑菌酮	9:1 至 1:18	3:1 至 1:6	2:1 至 1:4
咪唑菌酮	6:1 至 1:18	2:1 至 1:6	2:1 至 1:4
氯苯嘧啶醇	3:1 至 1:90	1:1 至 1:30	1:2 至 1:24
腈苯唑	3:1 至 1:30	1:1 至 1:10	1:1 至 1:10
甲呋酰苯胺	18:1 至 1:6	6:1 至 1:2	4:1 至 1:2
环酰菌胺	30:1 至 1:2	10:1 至 2:1	10:1 至 2:1
氟菌胺	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 1:1
拌种咯	75:1 至 1:9	25:1 至 1:3	15:1 至 2:1
苯锈啶	30:1 至 1:3	10:1 至 1:1	7:1 至 1:1

[0652]

组分（b）	典型的重量比	更典型的重量比	最典型的重量比
丁苯吗啉	30:1 至 1:3	10:1 至 1:1	7:1 至 1:1
腈苯吡菌酮（fenpyrazamine）	100:1 至 1:100	10:1 至 1:10	3:1 至 1:3
三苯基锡盐，如乙酸盐、氯化物或氢氧化物	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3
福美铁	300:1 至 1:2	100:1 至 2:1	30:1 至 4:1
嘧菌腙	30:1 至 1:5	10:1 至 1:2	7:1 至 1:2
氟啶胺	22:1 至 1:5	7:1 至 1:2	3:1 至 1:2
咯菌腈	7:1 至 1:12	2:1 至 1:4	2:1 至 1:4
氟酰菌胺	9:1 至 1:6	3:1 至 1:2	3:1 至 1:2
氟吗啉	9:1 至 1:18	3:1 至 1:6	3:1 至 1:3
氟吡菌胺	3:1 至 1:18	1:1 至 1:6	1:1 至 1:6
氟吡菌酰胺	15:1 至 1:90	5:1 至 1:30	3:1 至 1:3
氟氯菌核利	150:1 至 2:1	50:1 至 4:1	37:1 至 5:1
氟嘧菌酯	4:1 至 1:18	1:1 至 1:6	1:1 至 1:6
氟喹唑	4:1 至 1:12	1:1 至 1:4	1:1 至 1:4
氟硅唑	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3
磺菌胺	90:1 至 1:2	30:1 至 2:1	15:1 至 2:1
氟螨嗪	7:1 至 1:36	2:1 至 1:12	1:1 至 1:6
氟酰胺	18:1 至 1:6	6:1 至 1:2	4:1 至 1:2
粉唑醇	4:1 至 1:12	1:1 至 1:4	1:1 至 1:4
氟苯吡菌胺（fluxapyroxad）	12:1 至 1:9	4:1 至 1:3	2:1 至 1:3
灭菌丹	90:1 至 1:4	30:1 至 1:2	15:1 至 2:1
三乙膦酸铝	225:1 至 2:1	75:1 至 5:1	30:1 至 5:1
麦穗宁	45:1 至 1:4	15:1 至 1:2	11:1 至 2:1
呋霜灵	15:1 至 1:45	5:1 至 1:15	1:1 至 1:6
福拉比	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
克热净或双胍辛胺	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
己唑醇	15:1 至 1:36	5:1 至 1:12	1:1 至 1:5
恶霉灵	225:1 至 2:1	75:1 至 4:1	75:1 至 9:1
抑霉唑	7:1 至 1:18	2:1 至 1:6	1:1 至 1:5
酰胺唑	15:1 至 1:36	5:1 至 1:12	1:1 至 1:5
碘代丙炔基丁基甲氨酸酯	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
种菌唑	15:1 至 1:36	5:1 至 1:12	1:1 至 1:5
异稻瘟净	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
异菌脲	120:1 至 1:2	40:1 至 2:1	15:1 至 2:1

[0653]

组分（b）	典型的重量比	更典型的重量比	最典型的重量比
丙森锌	9:1 至 1:9	3:1 至 1:3	2:1 至 1:3
稻瘟灵	150:1 至 2:1	50:1 至 4:1	45:1 至 5:1
苯吡菌胺（isopyrazam）	12:1 至 1:9	4:1 至 1:3	2:1 至 1:3
异噻菌胺	12:1 至 1:9	4:1 至 1:3	2:1 至 1:3
春雷霉素	7:1 至 1:90	2:1 至 1:30	1:2 至 1:24
克收欣	7:1 至 1:18	2:1 至 1:6	2:1 至 1:4
代森锰锌	180:1 至 1:3	60:1 至 2:1	22:1 至 3:1
双炔酰菌胺	6:1 至 1:18	2:1 至 1:6	2:1 至 1:4
代森锰	180:1 至 1:3	60:1 至 2:1	22:1 至 3:1
灭派林	18:1 至 1:3	6:1 至 1:1	6:1 至 1:1
灭锈胺	7:1 至 1:36	2:1 至 1:12	1:1 至 1:6
消螨普	7:1 至 1:9	2:1 至 1:3	2:1 至 1:3
甲霜灵	15:1 至 1:45	5:1 至 1:15	1:1 至 1:6
甲霜灵-M	7:1 至 1:90	2:1 至 1:30	1:1 至 1:12
叶菌唑	3:1 至 1:18	1:1 至 1:6	1:1 至 1:6
磺菌威	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 1:1
代森联	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 1:1
苯氧菌胺	9:1 至 1:12	3:1 至 1:4	3:1 至 1:3
苯菌酮	6:1 至 1:12	2:1 至 1:4	2:1 至 1:4
腈菌唑	5:1 至 1:26	1:1 至 1:9	1:1 至 1:8
奈替芬	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
新阿苏仁（甲基肿酸铁）	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
氟苯嘧啶醇	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3
辛噻酮	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 1:1
呋酰胺	15:1 至 1:45	5:1 至 1:15	1:1 至 1:6
肟醚菌胺	9:1 至 1:12	3:1 至 1:4	3:1 至 1:3
恶霜灵	15:1 至 1:45	5:1 至 1:15	1:1 至 1:6
噁喹酸	30:1 至 1:9	10:1 至 1:3	7:1 至 1:2
噁咪唑	15:1 至 1:36	5:1 至 1:12	1:1 至 1:5
氧化萎锈灵	18:1 至 1:6	6:1 至 1:2	4:1 至 1:2
氧四环素	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3
稻瘟酯	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
戊菌唑	1:1 至 1:45	1:2 至 1:15	1:2 至 1:15
戊菌隆	150:1 至 1:2	50:1 至 2:1	11:1 至 2:1

[0654]

组分（b）	典型的重量比	更典型的重量比	最典型的重量比
戊苯吡菌胺	12:1 至 1:9	4:1 至 1:3	2:1 至 1:3
吡噻菌胺	12:1 至 1:9	4:1 至 1:3	2:1 至 1:3
亚磷酸及其盐	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
苯酞	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
啶氧菌酯	7:1 至 1:18	2:1 至 1:6	1:1 至 1:5
粉病灵	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3
多抗霉素	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3
烯丙异噻唑	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3
咪鲜安	22:1 至 1:4	7:1 至 1:1	7:1 至 1:2
腐霉利	45:1 至 1:3	15:1 至 1:1	11:1 至 2:1
霜霉威或霜霉威-盐酸盐	30:1 至 1:2	10:1 至 2:1	10:1 至 2:1
丙环唑	4:1 至 1:18	1:1 至 1:6	1:1 至 1:5
丙森锌	45:1 至 1:2	15:1 至 2:1	11:1 至 2:1
丙氧喹啉	3:1 至 1:36	1:1 至 1:12	1:1 至 1:12
硫菌威	9:1 至 1:18	3:1 至 1:6	3:1 至 1:3
丙硫菌唑	6:1 至 1:18	2:1 至 1:6	1:1 至 1:5
唑菌胺酯	9:1 至 1:18	3:1 至 1:6	2:1 至 1:4
唑胺菌酯	9:1 至 1:18	3:1 至 1:6	2:1 至 1:4
唑菌酯	9:1 至 1:18	3:1 至 1:6	2:1 至 1:4
定菌磷	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 1:1
吡菌苯威（pyribencarb）	15:1 至 1:6	5:1 至 1:2	4:1 至 1:2
啶斑肟	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3
嘧霉胺	30:1 至 1:6	10:1 至 1:2	3:1 至 1:2
甲氧苯啶菌（pyriofenone）	6:1 至 1:12	2:1 至 1:4	2:1 至 1:4
咯喹酮	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3
硝吡咯菌素	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
喹唑	4:1 至 1:12	1:1 至 1:4	1:1 至 1:4
灭螨猛	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
快诺芬	4:1 至 1:18	1:1 至 1:6	1:1 至 1:6
五氯硝基苯	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
硅噻菌胺	7:1 至 1:18	2:1 至 1:6	2:1 至 1:4
硅氟唑	15:1 至 1:36	5:1 至 1:12	1:1 至 1:5
螺环菌胺	22:1 至 1:4	7:1 至 1:2	5:1 至 1:2
链霉素	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3

[0655]

组分（b）	典型的重量比	更典型的重量比	最典型的重量比
硫	300:1 至 3:1	100:1 至 9:1	75:1 至 9:1
戊唑醇	7:1 至 1:18	2:1 至 1:6	1:1 至 1:5
异丁乙氧喹啉（tebufloquin）	100:1 至 1:100	10:1 至 1:10	3:1 至 1:3
克枯烂	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
四氯硝基苯	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
特比萘芬	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
氟醚唑	15:1 至 1:36	5:1 至 1:12	1:1 至 1:5
噻菌灵	45:1 至 1:4	15:1 至 1:2	11:1 至 2:1
噻呋灭	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3
托布津	45:1 至 1:3	15:1 至 2:1	11:1 至 2:1
甲基硫菌灵	45:1 至 1:3	15:1 至 2:1	11:1 至 2:1
二硫四甲秋兰姆	150:1 至 1:2	50:1 至 2:1	37:1 至 5:1
噻酰菌胺	12:1 至 1:9	4:1 至 1:3	2:1 至 1:3
甲基立枯磷	150:1 至 1:2	50:1 至 2:1	37:1 至 5:1
甲苯氟磺胺	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
三唑酮	15:1 至 1:36	5:1 至 1:12	1:1 至 1:5
三唑醇	15:1 至 1:36	5:1 至 1:12	1:1 至 1:5
嘧菌醇	3:1 至 1:90	1:1 至 1:30	1:2 至 1:24
唑菌嗪	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	15:1 至 2:1
三环唑	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3
十三吗啉	30:1 至 1:3	10:1 至 1:1	7:1 至 1:1
肟菌酯	6:1 至 1:18	2:1 至 1:6	2:1 至 1:4
氟菌唑	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3
噻氨灵	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3
垂吗酰胺	45:1 至 1:9	15:1 至 1:3	7:1 至 1:2
灭菌唑	15:1 至 1:36	5:1 至 1:12	1:1 至 1:5
烯效唑	15:1 至 1:36	5:1 至 1:12	1:1 至 1:5
井冈霉素	150:1 至 1:36	50:1 至 1:12	3:1 至 1:3
霜霉灭	6:1 至 1:18	2:1 至 1:6	2:1 至 1:4
乙烯菌核利	120:1 至 1:2	40:1 至 2:1	15:1 至 2:1
代森锌	150:1 至 1:2	50:1 至 2:1	37:1 至 5:1
福美锌	150:1 至 1:2	50:1 至 2:1	37:1 至 5:1

[0656]

组分（b）	典型的重量比	更典型的重量比	最典型的重量比
草酰胺	6:1 至 1:18	2:1 至 1:6	2:1 至 1:4
5-氯-6-（2,4,6-三氟苯基）-7-（4-甲基哌啶-1-基）[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶	15:1 至 1:36	5:1 至 1:12	1:1 至 1:6
N-[2-[4-[[3-（4-氯苯基）-2-丙炔-1-基]氧代]-3-甲氧基苯基]乙基]-3-甲基-2-[（甲基磺酰基）氨基]丁酰胺	6:1 至 1:18	2:1 至 1:6	2:1 至 1:4
N-[2-[4-[[3-（4-氯苯基）-2-丙炔-1-基]氧代]-3-甲氧基苯基]乙基]-3-甲基-2-[（乙磺酰基）氨基]丁酰胺	6:1 至 1:18	2:1 至 1:6	2:1 至 1:4
2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4*H*-1-苯并吡喃-4-酮	3:1 至 1:36	1:1 至 1:12	1:1 至 1:12
3-[5-（4-氯苯基）-2,3-二甲基-3-异噁唑烷基]吡啶	15:1 至 1:9	5:1 至 1:3	3:1 至 1:3
N'-[4-[[3-[（4-氯苯基）甲基]-1,2,4-噻二唑-5-基]氧]-2,5-二甲基苯基]-*N*-乙基-*N*-甲基甲亚胺酰胺	20:1 至 1:20	8:1 至 1:8	3:1 至 1:3
N-[1-[[[1-（4-氯基苯基）乙基]磺酰基]甲基]丙基]氨基甲酸 4-氯苯酯	6:1 至 1:18	2:1 至 1:6	2:1 至 1:4
N-[[（环丙基甲氧基）氨基][6-（二氟甲氧基）-2,3-二氟苯基]亚甲基]苯乙酰胺	1:1 至 1:90	1:2 至 1:30	1:2 至 1:24
α-[甲氧基亚氨基]-N-甲基-2-[[[1-[3-（三氟甲基）苯基]乙氧基]亚氨基]甲基]苯乙酰胺	9:1 至 1:18	3:1 至 1:6	3:1 至 1:3
N'-[4-[4-氯-3-（三氟甲基）苯氧基]-2,5-二甲基苯基]-*N*-乙基-*N*-甲基甲亚胺酰胺	15:1 至 1:18	5:1 至 1:6	3:1 至 1:3
N-（4-氯-2-硝基苯基）-*N*-乙基-4-甲基苯磺酰胺	15:1 至 1:18	5:1 至 1:6	3:1 至 1:3
2-[[[3-（2,6-二氯苯基）-1-甲基-2-丙烯-1-亚基]氨基]氧]甲基]-α-（甲氧基亚氨基）-N-甲基苯乙酰胺	9:1 至 1:18	3:1 至 1:6	3:1 至 1:3
N-/4-[[[[（1-甲基-1*H*-四唑-5-基）苯基亚甲基]氨基]氧]甲基]-2-噻唑基]氨基甲酸戊酯	9:1 至 1:18	3:1 至 1:6	3:1 至 1:3
N-/6-[[[[（1-甲基-1*H*-四唑-5-基）苯基亚甲基]氨基]氧]甲基]-2-吡啶基]氨基甲酸戊酯	9:1 至 1:18	3:1 至 1:6	3:1 至 1:3
2-[（3-溴-6-喹啉基）氧]-*N*-（1,1-二甲基-2-丁炔-1-基）-2-（甲硫基）乙酰胺	5:1 至 1:22	2:1 至 1:8	2:1 至 1:4
2-[（3-乙炔基-6-喹啉基）氧]-*N*-[1-（羟甲基）-1-甲基-2-丙炔-1-基]-2-（甲硫基）乙酰胺	5:1 至 1:22	2:1 至 1:8	2:1 至 1:4
N-（1,1-二甲基-2-丁炔-1-基）-2-[（3-乙炔基-6-喹啉基）氧]-2-（甲硫基）乙酰胺	5:1 至 1:22	2:1 至 1:8	2:1 至 1:4

[0657] 如已经注释的，本发明包含实施例，其中所述组合物包含组分（a）和（b），组分（b）包含至少一种两个基团的每一个选自（b1）至（b46）的杀真菌化合物。表 C1 至 C43 列出了具体的混合物（化合物序号指的是在表 A 中化合物的索引）以举例说明实施例，其中组分（b）包含至少一种两个基团的每一个选自（b1）至（b46）的杀真菌化合物。在表 C1 中，在栏标题“组分（a）”和“组分（b）”下面的每行具体地公开了为化合物 3 组分（a）混合物，所述

组合物具有至少两种组分(b)的杀真菌化合物。在标题“例证性比率”下面的条目以关于公开的混合物序列公开了组分(a)与每个组分(b)杀真菌化合物三种具体的重量比。例如,第一行公开了化合物 3 与环丙唑醇和嘧菌酯的混合物,并列出了化合物 3 与环丙唑醇与嘧菌酯的 1:1:1,2:1:1 或 3:1:1 的重量比。

[0658] 表 C1

[0659]

组分（a）	组分（b）		例证性比率（*）		
化合物 3	环丙唑醇	嘧菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	环丙唑醇	克收欣	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	环丙唑醇	啶氧菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	环丙唑醇	唑菌胺酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	环丙唑醇	唑胺菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	环丙唑醇	唑菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	环丙唑醇	肟菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	环丙唑醇	广谱杀菌剂	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	环丙唑醇	啶酰菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	环丙唑醇	环氟菌胺	1:2:1	2:2:1	3:2:1
化合物 3	环丙唑醇	氟吡菌酰胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	环丙唑醇	萘吡菌胺（isopyrazam）	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	环丙唑醇	苯菌酮	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	环丙唑醇	吡噻菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	环丙唑醇	丙氧喹啉	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	环丙唑醇	甲氧苯啶菌（pyriofenone）	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	环丙唑醇	快诺芬	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	环丙唑醇	环丙吡菌胺（sedaxane）	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	环丙唑醇	啶氧菌酯 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1

[0660]

组分（a）	组分（b）			例证性比率（*）		
化合物 3	环丙唑醇	肟菌酯	丙氟唑啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	恶醚唑	嘧菌酯		1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	恶醚唑	克收欣		1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	恶醚唑	啶氧菌酯		1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	恶醚唑	唑菌胺酯		1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	恶醚唑	唑胺菌酯		1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	恶醚唑	唑菌酯		1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	恶醚唑	肟菌酯		1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	恶醚唑	广谱杀菌剂		1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	恶醚唑	啶酰菌胺		1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	恶醚唑	环氟菌胺		1:2:1	2:2:1	3:2:1
化合物 3	恶醚唑	氟吡菌酰胺		1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	恶醚唑	苯吡菌胺（isopyrazam）		1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	恶醚唑	苯菌酮		1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	恶醚唑	吡嘧菌胺		1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	恶醚唑	丙氧喹啉		1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	恶醚唑	甲氧苯啶菌（pyriofenone）		1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	恶醚唑	快诺芬		1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	恶醚唑	环丙吡菌胺（sedaxane）		1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	恶醚唑	啶氧菌酯	丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	恶醚唑	肟菌酯	丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	氟环唑	嘧菌酯		1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	氟环唑	克收欣		1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	氟环唑	啶氧菌酯		1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	氟环唑	唑菌胺酯		1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	氟环唑	唑胺菌酯		1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	氟环唑	唑菌酯		1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	氟环唑	肟菌酯		1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	氟环唑	广谱杀菌剂		1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	氟环唑	啶酰菌胺		1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	氟环唑	环氟菌胺		1:2:1	2:2:1	3:2:1
化合物 3	氟环唑	氟吡菌酰胺		1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	氟环唑	苯吡菌胺（isopyrazam）		1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	氟环唑	苯菌酮		1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	氟环唑	吡嘧菌胺		1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	氟环唑	丙氧喹啉		1:1:1	2:1:1	3:1:1

[0661]

组分（a）	组分（b）		例证性比率（*）		
化合物 3	氟环唑	甲氧苯啶菌（pyriofenone）	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	氟环唑	快诺芬	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	氟环唑	环丙吡菌胺（sedaxane）	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	氟环唑	啶氧菌酯 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	氟环唑	肟菌酯 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	叶菌唑	嘧菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	叶菌唑	克收欣	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	叶菌唑	啶氧菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	叶菌唑	唑菌胺酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	叶菌唑	唑胺菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	叶菌唑	唑菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	叶菌唑	肟菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	叶菌唑	广谱杀菌剂	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	叶菌唑	啶酰菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	叶菌唑	环氟菌胺	1:2:1	2:2:1	3:2:1
化合物 3	叶菌唑	氟吡菌酰胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	叶菌唑	苯吡菌胺（isopyrazam）	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	叶菌唑	苯菌酮	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	叶菌唑	吡噻菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	叶菌唑	丙氧喹啉	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	叶菌唑	甲氧苯啶菌（pyriofenone）	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	叶菌唑	快诺芬	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	叶菌唑	环丙吡菌胺（sedaxane）	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	叶菌唑	啶氧菌酯 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	叶菌唑	肟菌酯 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	腈菌唑	嘧菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	腈菌唑	克收欣	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	腈菌唑	啶氧菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	腈菌唑	唑菌胺酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	腈菌唑	唑胺菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	腈菌唑	唑菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	腈菌唑	肟菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	腈菌唑	广谱杀菌剂	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	腈菌唑	啶酰菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	腈菌唑	环氟菌胺	1:2:1	2:2:1	3:2:1

[0662]

组分（a）	组分（b）		例证性比率（*）		
化合物 3	腈菌唑	氟吡菌酰胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	腈菌唑	萘吡菌胺（isopyrazam）	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	腈菌唑	苯菌酮	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	腈菌唑	吡噻菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	腈菌唑	丙氧喹啉	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	腈菌唑	甲氧苯啶菌（pyriofenone）	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	腈菌唑	快诺芬	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	腈菌唑	环丙吡菌胺（sedaxane）	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	腈菌唑	啶氧菌酯 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	腈菌唑	肟菌酯 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	丙硫菌唑	嘧菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	丙硫菌唑	克收欣	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	丙硫菌唑	啶氧菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	丙硫菌唑	唑菌胺酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	丙硫菌唑	唑胺菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	丙硫菌唑	唑菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	丙硫菌唑	肟菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	丙硫菌唑	广谱杀菌剂	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	丙硫菌唑	啶酰菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	丙硫菌唑	环氟菌胺	1:2:1	2:2:1	3:2:1
化合物 3	丙硫菌唑	氟吡菌酰胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	丙硫菌唑	萘吡菌胺（isopyrazam）	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	丙硫菌唑	苯菌酮	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	丙硫菌唑	吡噻菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	丙硫菌唑	丙氧喹啉	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	丙硫菌唑	甲氧苯啶菌（pyriofenone）	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	丙硫菌唑	快诺芬	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	丙硫菌唑	环丙吡菌胺（sedaxane）	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	丙硫菌唑	啶氧菌酯 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	丙硫菌唑	肟菌酯 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	戊唑醇	嘧菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	戊唑醇	克收欣	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	戊唑醇	啶氧菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	戊唑醇	唑菌胺酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1

[0663]

组分（a）	组分（b）		例证性比率（*）		
化合物 3	戊唑醇	唑胺菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	戊唑醇	唑菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	戊唑醇	肟菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	戊唑醇	广谱杀菌剂	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	戊唑醇	啶酰菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	戊唑醇	环氟菌胺	1:2:1	2:2:1	3:2:1
化合物 3	戊唑醇	氟吡菌酰胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	戊唑醇	萘吡菌胺（isopyrazam）	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	戊唑醇	苯菌酮	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	戊唑醇	吡噻菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	戊唑醇	丙氧喹啉	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	戊唑醇	甲氧苯啶菌（pyriofenone）	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	戊唑醇	快诺芬	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	戊唑醇	环丙吡菌胺（sedaxane）	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	戊唑醇	啶氧菌酯 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	戊唑醇	肟菌酯 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1

[0664] （*）按顺序组分（a）相对于组分（b）的重量比

[0665] 表 C2 至 C43 每个构造与上表 C1 中相同，不同的是栏标题下面的条目“组分（a）”被下文所示的相应组分（a）的栏条目替代。因此，例如在表 C2 中，栏标题“组分（a）”下面的条目全列举为“化合物 7”，并且在表 C2 栏标题下面的第一行具体公开了化合物 7 与环丙唑醇和嘧菌酯的混合物，和化合物 7：环丙唑醇：嘧菌酯例证性的 1:1:1，2:1:1 和 3:1:1 的重量比。表 C3 至 C43 类似地构造。

[0666]

表编号	组分（a）栏条目	表编号	组分（a）栏条目
C2	化合物 7	C23	化合物 252
C3	化合物 8	C24	化合物 253
C4	化合物 13	C25	化合物 254
C5	化合物 17	C26	化合物 257
C6	化合物 40	C27	化合物 258
C7	化合物 47	C28	化合物 259
C8	化合物 81	C29	化合物 260
C9	化合物 82	C30	化合物 261

[0667]

C10	化合物 122	C31	化合物 262
C11	化合物 136	C32	化合物 263
C12	化合物 143	C33	化合物 264
C13	化合物 144	C34	化合物 265
C14	化合物 161	C35	化合物 266
C15	化合物 195	C36	化合物 267
C16	化合物 238	C37	化合物 268
C17	化合物 239	C38	化合物 269
C18	化合物 240	C39	化合物 270
C19	化合物 241	C40	化合物 271
C20	化合物 244	C41	化合物 273
C21	化合物 245	C42	化合物 275
C22	化合物 247	C43	化合物 276

[0668] 值得注意的是本发明的组合物，所述组合物包含具有至少一种具有与式 1 化合物不同作用位点的其它杀真菌化合物的式 1（或其 N- 氧化物或其盐）化合物。在某些情况下，与至少一种具有类似控制范围但是不同作用位点的其它杀真菌化合物组合，对于抗性管理将是尤其有利的。因此，本发明的组合物可有利地包含至少一种杀真菌活性化合物，所述杀真菌活性化合物选自如上所述的（b1）至（b46），其具有类似的控制范围但不同的作用位点。

[0669] 组分（a）或组分（a）与组分（b）的组合物可与一个或多个其它生物活性化合物或试剂进一步混合以形成多组分杀虫剂，赋予甚至更广谱的农业保护，所述生物活性化合物或试剂包括杀昆虫剂、杀线虫剂杀菌剂、杀螨剂、除草剂、除草剂安全剂、生长调节剂如昆虫蜕皮抑制剂和生根刺激剂、化学不育剂、化学信息素、拒斥剂、诱虫剂、信息素、取食刺激剂、植物营养素、其它生物学活性化合物或昆虫致病细菌、病毒或真菌。因此本发明还涉及组合物，所述组合物包含杀真菌有效量的组分（a），或组分（a）与组分（b）的混合物，以及生物有效量的至少一种附加生物活性化合物或试剂，并且还可包含至少一种表面活性剂、固体稀释剂或液体稀释剂。其它生物活性化合物或试剂也可单独配置到包含至少一种表面活性剂、固体或液体稀释剂的组合物中。对于本发明的组合物，可将一种或多种其它生物学活性化合物或试剂与组分（a）和 / 或（b）配制在一起以形成预混物，或者可分别配制一种或多种其它生物学活性化合物或试剂以及 组分（a）和（b），并且在应用前将制剂混合（例如在喷雾器槽中），或作为另外一种选择，进行相继施用。

[0670] 可与组分（a），或组分（a）和组分（b）的组合物配制在一起的此类生物学活性化合物或试剂的实例是：杀昆虫剂，如阿巴美丁、高灭磷、啶虫脒、乙酰虫腈、氟丙菊酯、涕灭威、磺胺螨酯、双甲脒、阿维菌素、印苦楝子素、谷硫磷、联苯菊酯、联苯肼酯、双三氟虫脲、扑虱灵、克百威、杀螟丹、灭螨猛、溴虫腈、定虫隆、氯虫苯甲酰胺、氯蜱硫磷、甲基氯蜱硫磷、克氯苯、可芬诺、可尼丁、氰虫酰胺、丁氟螨酯、氟氯氰菊酯、β - 氟氯氰菊酯、氟氯氰菊酯、γ - 氟氯氰菊酯、λ - 氟氯氰菊酯、三环锡、氯氰菊酯、灭蝇胺、溴氢菊酯、丁醚脲、敌匹硫磷、三氯杀螨醇、迪厄尔丁、除螨灵、除虫脲、四氟甲醚菊酯、乐果、呋虫胺、二苯丙醚、甲氨基阿维菌素、硫丹、顺式氰戊菊酯、乙虫腈、乙螨唑、苯线磷、喹螨醚、苯丁锡、苯硫威、苯氧威、甲氰菊酯、唑螨酯、腈苯苯醚菊酯、氟虫腈、氟啶虫酰胺、氟虫酰胺、氟氰戊菊酯、氟胺氰菊酯、嘧虫胺、

氟虫脲、大福松、氯虫酰肼、氟铃脲、噻螨酮、伏蚁腙、imicyafos、吡虫啉、茚虫威、异柳磷、虱螨脲、马拉硫磷、氯氟醚菊酯、氰氟虫腙、蜗牛敌、甲胺磷、杀扑磷、乙肟威、甲氧普烯、甲氧滴滴涕、甲氧虫酰肼、甲氧卞氟菊酯、杀螨菌素肟、久效磷、烟碱、烯啶虫胺、硝乙脲噻唑、双苯氟脲、多氟虫酰脲、草氨酰、对硫磷、甲基对硫磷、扑灭司林、甲拌磷、伏杀硫磷、亚胺硫磷、磷胺、抗蚜威、丙溴磷、丙氟菊酯、克螨特(propargite)、硫菌威、丙苯烃菊酯、吡蚜酮、吡嗪氟虫腈、除虫菊酯、哒螨酮、啶虫丙醚、新喹唑啉类杀虫剂(pyrifluquinazon)、吡啶氟虫腈、蚊蝇醚、鱼藤酮、理阿诺碱、多菌虫素、多杀菌素、螺螨酯、螺甲螨酯、螺虫乙酯、氟啶虫胺腈、硫丙磷、虫酰肼、吡螨胺、伏虫脲、七氟菊酯、特丁硫磷、司替罗磷、四氟醚菊酯、噻虫啉、噻虫嗪、硫双灭多威、杀虫双、唑虫酰胺、四溴菊酯、唑蚜威、敌百虫、杀虫脲;杀线虫剂例如涕灭威、imicyafos、草氨酰和苯线磷;杀菌剂,诸如链霉素;杀螨剂,如双甲脒、灭螨猛、克氯苯、杀螨剂(cyenopyrafen)、三环锡、三氯杀螨醇、除螨灵、乙螨唑、喹螨醚、苯丁锡、甲氰菊酯、唑螨酯、噻螨酮、克螨特(propargite)、哒螨酮和吡螨胺;以及生物剂,包括昆虫致病细菌例如苏 云金芽孢杆菌鲇泽亚种、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种、以及苏云金芽孢杆菌的包封的 Δ-内毒素(例如 Cellcap、MPV、MPVII);昆虫病原真菌,例如绿僵菌;和昆虫病原病毒,包括杆状病毒、核型多角体病毒(NPV)诸如 HzNPV、AfNPV;以及颗粒体病毒(GV),诸如 CpGV。

[0671] 这些农学保护剂(即杀虫剂,杀真菌剂,杀线虫剂,杀螨剂,除草剂和生物制剂)的一般参考文献包括“The Pesticide Manual”第 13 版(C.D.S.Tomlin 编辑,British Crop Protection Council,Farnham,Surrey,U.K.,2003 和 The BioPesticide Manual 第二版,L.G.Copping 编辑,British Crop Protection Council,Farnham,Surrey,U.K.,2001。

[0672] 对于其中使用一种或多种这些不同混合组分的实施例,这些不同混合组分(总量)与组分(a)或组分(a)与组分(b)的混合物)的重量比通常介于约 1:3000 和约 3000:1 之间。值得注意的是介于约 1:100 和约 3000:1 之间,或介于约 1:30 和约 300:1 之间的重量比(例如介于约 1:1 和约 30:1 之间的比率)。显然,包含这些附加组分可使病害控制范围超越组分(a)或组分(a)与组分(b)的混合物对病害的控制范围。

[0673] 可将组分(a)化合物和/或其与组分(b)化合物和/或一种或多种其它生物活性化合物或试剂的组合施用到被遗传转化以对无脊椎害虫表达蛋白质毒性(诸如苏云金芽孢杆菌 Δ-内毒素)的植物上。外源地单独施用本组分(a)或与组分(b)组合施用的效果可与表达的毒素蛋白质协同。

[0674] 值得注意的是,如在发明内容中所述的包含组分(a)或组分(a)和(b)的组合或组合物,还包含至少一种无脊椎害虫控制化合物或试剂(如,杀昆虫剂、杀螨剂)。尤其值得注意的是包含组分(a)和至少一种(即,一种或多种)无脊椎害虫控制化合物或试剂的组合物,其然后可随后与组分(b)混合以提供包含组分(a)和(b)以及一种或多种无脊椎害虫控制化合物或试剂的组合物。作为另外一种选择,最初没有与组分(b)混合,包含组分(a)与至少一种无脊椎害虫控制试剂的生物学有效量的组合物,可施用到植物或植物种子(直接或通过植物或植物种子的环境)以保护所述植物或植物种子不受由真菌病原体引起的病害和由无脊椎害虫引起的损害。

[0675] 对于其中使用一种或多种无脊椎害虫控制化合物的实施例,这些化合物(总量)与组分(a)化合物的重量比通常介于约 1:3000 和约 3000:1 之间。值得注意的是介于约 1:300

和约 300:1 之间的重量比(例如介于约 1:30 和约 30:1 之间的比率)。本领域的技术人员可易于通过简单的实验来确定获得所期望生物活性范围而需要的活性成分的生物学有效量。

[0676] 值得注意的是本发明的组合物,其除包含组分(a)化合物,单独或与组分(b)组合以外,还包含至少一种选自以下的无脊椎害虫控制化合物或试剂:阿巴美丁、高灭磷、啶虫脒、乙酰虫腈、氟丙菊酯、涕灭威、磺胺螨酯、双甲脒、阿维菌素、印苦楝子素、谷硫磷、联苯菊酯、联苯肼酯、双三氟虫脲、扑虱灵、克百威、杀螟丹、灭螨猛、溴虫腈、定虫隆、氯虫苯甲酰胺、氯蜱硫磷、甲基氯蜱硫磷、克氯苯、可芬诺、可尼丁、氰虫酰胺、丁氟螨酯、氟氯氰菊酯、β-氟氯氰菊酯、氟氯氰菊酯、γ-氟氯氰菊酯、λ-氟氯氰菊酯、三环锡、氯氰菊酯、灭蝇胺、溴氢菊酯、丁醚脲、敌匹硫磷、三氯杀螨醇、迪厄尔丁、除螨灵、除虫脲、四氟甲醚菊酯、乐果、呋虫胺、二苯丙醚、甲氨基阿维菌素、硫丹、顺式氰戊菊酯、乙虫腈、乙螨唑、苯线磷、喹螨醚、苯丁锡、苯硫威、苯氧威、甲氰菊酯、唑螨酯、腈苯苯醚菊酯、氟虫腈、氟啶虫酰胺、氟虫酰胺、氟氰戊菊酯、氟胺氰菊酯、嘧虫胺、氟虫脲、大福松、氯虫酰肼、氟铃脲、噻螨酮、伏蚁腙、imicyafos、吡虫啉、茚虫威、异柳磷、虱螨脲、马拉硫磷、氯氟醚菊酯、氰氟虫腙、蜗牛敌、甲胺磷、杀扑磷、乙肟威、甲氧普烯、甲氧滴滴涕、甲氧虫酰肼、甲氧卞氟菊酯、杀螨菌素肟、久效磷、烟碱、烯啶虫胺、硝乙脲噻唑、双苯氟脲、多氟虫酰脲、草氨酰、对硫磷、甲基对硫磷、扑灭司林、甲拌磷、伏杀硫磷、亚胺硫磷、磷胺、抗蚜威、丙溴磷、丙氟菊酯、克螨特(propargite)、丙苯烃菊酯、吡蚜酮、吡嗪氟虫腈、除虫菊酯、哒螨酮、啶虫丙醚、新喹唑啉类杀虫剂(pyrifluquinazon)、吡啶氟虫腈、蚊蝇醚、鱼藤酮、理阿诺碱、多菌虫素、多杀菌素、螺螨酯、螺甲螨酯、螺虫乙酯、氟啶虫胺腈、硫丙磷、虫酰肼、吡螨胺、伏虫脲、七氟菊酯、特丁硫磷、司替罗磷、四氟醚菊酯、噻虫啉、噻虫嗪、硫双灭多威、杀虫双、唑虫酰胺、四溴菊酯、唑蚜威、敌百虫、杀虫脲、苏云金芽孢杆菌亚种。苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种、核型多角体病毒、苏云金 芽孢杆菌的胶囊包封 Δ-内毒素、杆状病毒、昆虫致病细菌、昆虫病原病毒和昆虫病原真菌。值得注意的是上述清单不包括氯氟醚菊酯、氟啶虫胺腈和四氟醚菊酯。

[0677] 在某些情况下,组分(a)化合物,单独或与组分(b)的组合与其它生物活性(尤其是无脊椎害虫控制)化合物或试剂(即,活性成分)可导致大于添加剂(即,协同)效应。降低释放到环境中的活性成分量,同时确保有效的害虫防治,一直是人们所期望的。当在施用量下发生无脊椎害虫防治活性成分协同作用,赋予农学上符合要求的无脊椎害虫防治水平,此类组合可有利地用于降低作物生产成本,并且降低环境载荷。

[0678] 表 D1 列出了无脊椎害虫控制试剂与作为组分(a)化合物的化合物 3 (在索引表 A 中确定的)例证性混合物和组合物具体的组合,所述混合物和组合物包含这些活性成分,以及依照本发明使用它们的方法。表 D1 第二栏列出了具体的无脊椎害虫控制剂(例如第一栏中的“阿巴美丁”)。表 D1 第三栏列出了无脊椎害虫控制剂的作用模式(如果已知的话)或化学类别。表 D1 第四栏列出了所述无脊椎害虫控制试剂通常施用的量相对于化合物 3 单独或与组分(b)组合的重量比范围的实施例(如按重量计“50:1 至 1:50”阿巴美丁相对于化合物 3)。因此,例如表 D1 第一行具体公开,通常可以介于 50:1 至 1:50 之间的重量比施用化合物 3 与阿巴美丁的组合。表 D1 的其余行可类似进行解释。

[0679] 表 D1

[0680]

组分（a）	无脊椎害虫控制剂	作用模式或化学类别	典型的重量比
化合物 3	阿巴美丁	大环内酯类	50:1 至 1:50
化合物 3	啶虫脒	新烟碱类	150:1 至 1:200
化合物 3	双甲脒	章鱼胺受体配体	200:1 至 1:100
化合物 3	阿维菌素	大环内酯类	50:1 至 1:50
化合物 3	印苦楝子素	蜕皮激素激动剂	100:1 至 1:120
化合物 3	β-氟氯氰菊酯	钠通道调节剂	150:1 至 1:200
化合物 3	联苯菊酯	钠通道调节剂	100:1 至 1:10
化合物 3	扑虱灵	甲壳质合成抑制剂	500:1 至 1:50
化合物 3	杀螟丹	沙蚕毒素类似物	100:1 至 1:200
化合物 3	氟虫苯甲酰胺	鱼尼汀受体配体	100:1 至 1:120

[0681]

组分（a）	无脊椎害虫控制剂	作用模式或化学类别	典型的重量比
化合物 3	溴虫腈	线粒体电子转运抑制剂	300:1 至 1:200
化合物 3	氯蜱硫磷	胆碱酯酶抑制剂	500:1 至 1:200
化合物 3	可尼丁	新烟碱类	100:1 至 1:400
化合物 3	氯虫酰胺	鱼尼汀受体配体	100:1 至 1:120
化合物 3	氟氯氰菊酯	钠通道调节剂	150:1 至 1:200
化合物 3	氟氯氰菊酯	钠通道调节剂	150:1 至 1:200
化合物 3	氯氰菊酯	钠通道调节剂	150:1 至 1:200
化合物 3	赛灭净	甲壳质合成抑制剂	400:1 至 1:50
化合物 3	溴氰菊酯	钠通道调节剂	50:1 至 1:400
化合物 3	迪厄尔丁	环二烯类杀虫剂	200:1 至 1:100
化合物 3	呋虫胺	新烟碱类	150:1 至 1:200
化合物 3	二苯丙醚	蜕皮抑制剂	150:1 至 1:200
化合物 3	甲氨基阿维菌素	大环内酯类	50:1 至 1:10
化合物 3	硫丹	环二烯类杀虫剂	200:1 至 1:100
化合物 3	顺式氰戊菊酯	钠通道调节剂	100:1 至 1:400
化合物 3	乙虫腈	GABA 调节的氯离子通道阻隔剂	200:1 至 1:100
化合物 3	苯硫威		150:1 至 1:200
化合物 3	苯氧威	保幼激素模拟物	500:1 至 1:100
化合物 3	腈苯苯醚菊酯	钠通道调节剂	150:1 至 1:200
化合物 3	氟虫腈	GABA 调节的氯离子通道阻隔剂	150:1 至 1:100
化合物 3	氟啶虫酰胺		200:1 至 1:100
化合物 3	氟虫酰胺	鱼尼汀受体配体	100:1 至 1:120
化合物 3	氟虫脲	甲壳质合成抑制剂	200:1 至 1:100
化合物 3	氟铃脲	甲壳质合成抑制剂	300:1 至 1:50
化合物 3	伏蚁腙	线粒体电子转运抑制剂	150:1 至 1:250
化合物 3	吡虫啉	新烟碱类	1000:1 至 1:1000
化合物 3	茚虫威	钠通道调节剂	200:1 至 1:50
化合物 3	λ-氟氯氰菊酯	钠通道调节剂	50:1 至 1:250
化合物 3	虱螨脲	甲壳质合成抑制剂	500:1 至 1:250
化合物 3	氟氯醚菊酯	钠通道调节剂	100:1 至 1:400
化合物 3	氟氯虫腙		200:1 至 1:200
化合物 3	乙酚威	胆碱酯酶抑制剂	500:1 至 1:100
化合物 3	甲氧普烯	保幼激素模拟物	500:1 至 1:100
化合物 3	甲氧虫酰肼	蜕皮激素激动剂	50:1 至 1:50
化合物 3	烯啶虫胺	新烟碱类	150:1 至 1:200
化合物 3	硝乙噻唑	新烟碱类	150:1 至 1:200
化合物 3	双苯氟脲	甲壳质合成抑制剂	500:1 至 1:150
化合物 3	草氨酰	胆碱酯酶抑制剂	200:1 至 1:200

[0682]

组分（a）	无脊椎害虫控制剂	作用模式或化学类别	典型的重量比
化合物 3	吡蚜酮		200:1 至 1:100
化合物 3	除虫菊酯	钠通道调节剂	100:1 至 1:10
化合物 3	哒螨酮	线粒体电子转运抑制剂	200:1 至 1:100
化合物 3	啶虫丙醚		200:1 至 1:100
化合物 3	蚊蝇醚	保幼激素模拟物	500:1 至 1:100
化合物 3	理阿诺碱	鱼尼汀受体配体	100:1 至 1:120
化合物 3	多菌虫素	大环内酯类	150:1 至 1:100
化合物 3	多杀菌素	大环内酯类	500:1 至 1:10
化合物 3	季酮螨酯	脂质生物合成抑制剂	200:1 至 1:200
化合物 3	螺甲螨酯	脂质生物合成抑制剂	200:1 至 1:200
化合物 3	氟啶虫胺腈		200:1 至 1:200
化合物 3	虫酰肼	蜕皮激素激动剂	500:1 至 1:250
化合物 3	四氟醚菊酯	钠通道调节剂	100:1 至 1:40
化合物 3	噻虫啉	新烟碱类	100:1 至 1:200
化合物 3	噻虫嗪	新烟碱类	1250:1 至 1:1000
化合物 3	硫双灭多威	胆碱酯酶抑制剂	500:1 至 1:400
化合物 3	杀虫双		150:1 至 1:100
化合物 3	四溴菊酯	钠通道调节剂	150:1 至 1:200
化合物 3	唑蚜威	胆碱酯酶抑制剂	250:1 至 1:100
化合物 3	杀虫脒	甲壳质合成抑制剂	200:1 至 1:100
化合物 3	苏云金芽孢杆菌	生物剂	50:1 至 1:10
化合物 3	苏云金芽孢杆菌 Δ-内毒素	生物剂	50:1 至 1:10
化合物 3	NPV（例如 Gemstar）	生物剂	50:1 至 1:10

[0683] 表 D2 至 D43 每个构造与上表 D1 中相同，不同的是栏标题下面的条目“组分（a）”被下文所示的相应组分（a）的栏条目替代。因此，例如，表 D2 中栏标题下面的条目“组分（a）”全列举为“化合物 7”，并且表 D2 中栏标题下面的第一行具体公开了化合物 7 与阿巴美丁的混合物。表 D3 至 D43 类似地构造。

[0684]

表编号	组分（a）栏条目	表编号	组分（a）栏条目
D2	化合物 7	D23	化合物 252
D3	化合物 8	D24	化合物 253
D4	化合物 13	D25	化合物 254

[0685]

表编号	组分（a）栏条目	表编号	组分（a）栏条目
D5	化合物 17	D26	化合物 257
D6	化合物 40	D27	化合物 258
D7	化合物 47	D28	化合物 259
D8	化合物 81	D29	化合物 260
D9	化合物 82	D30	化合物 261
D10	化合物 122	D31	化合物 262
D11	化合物 136	D32	化合物 263
D12	化合物 143	D33	化合物 264
D13	化合物 144	D34	化合物 265
D14	化合物 161	D35	化合物 266
D15	化合物 195	D36	化合物 267
D16	化合物 238	D37	化合物 268
D17	化合物 239	D38	化合物 269
D18	化合物 240	D39	化合物 270
D19	化合物 241	D40	化合物 271
D20	化合物 244	D41	化合物 273
D21	化合物 245	D42	化合物 275
D22	化合物 247	D43	化合物 276

[0686] 用于和组分(a)化合物混合的无脊椎害虫控制剂(例如杀昆虫剂和杀螨剂)的一个实施例包括钠通道调节剂，诸如联苯菊酯、氯氰菊酯、氟氯氰菊酯、λ-氟氯氰菊酯、氟氯氰菊酯、β-氟氯氰菊酯、溴氢菊酯、四氟甲醚菊酯、顺式氰戊菊酯、腈苯苯醚菊酯、茚虫威、氯氟醚菊酯、甲氧卞氟菊酯、丙氟菊酯、除虫菊酯、四氟醚菊酯和四溴菊酯；胆碱酯酶抑制剂例如氯蜱硫磷、乙肟威、草氨酰、硫双灭多威和唑蚜威；新烟碱类例如啶虫脒、可尼丁、呋虫胺、吡虫啉、烯啶虫胺、硝乙脲噻唑、噻虫啉和噻虫嗪；大环内酯类杀虫剂例如多菌虫素、多杀菌素、阿巴美丁、阿维菌素和甲氨基阿维菌素；GABA（γ-氨基丁酸）调节的氯化物通道阻断剂例如硫丹、乙虫腈和氟虫腈；甲壳质合成抑制剂例如扑虱灵、赛灭净、氟虫脲、氟铃脲、虱螨脲、双苯氟脲、多氟虫酰脲和杀虫脲；保幼激素模拟物例如二苯丙醚、苯氧威、甲氧普烯和蚊蝇醚；章鱼胺受体配体例如双甲脒；蜕皮素激动剂例如印苦楝子素、甲氧虫酰肼和虫酰肼；理阿诺碱受体配体，如理阿诺碱，氨茴酸二酰胺，如氯虫苯甲酰胺、氰虫酰胺和氟虫酰胺；沙蚕毒素类似物例如杀螟丹；线粒体电子传递抑制剂例如溴虫腈、伏蚁腙和 哒螨酮；脂质生物合成抑制剂例如季酮螨酯和螺甲螨酯；环二烯类杀虫剂例如迪厄尔丁；丁氟螨酯；苯硫威；氟啶虫酰胺；氰氟虫腙；pyrafluprole；啶虫丙醚；吡啶氟虫腈(pyriprole)；吡蚜酮；螺虫乙酯；和杀虫双。与组分(a)化合物混合的生物制剂的一个实施例包括核型多角体病毒诸如 HzNPV 和 AfNPV；苏云金芽孢杆菌和苏云金芽孢杆菌的包封的 Δ-内毒素例如 Cellcap、MPV 和 MPVII；以及天然存在和遗传修饰的病毒杀虫剂，包括杆状病毒科成员以及昆虫病原真菌。值得注意的是包含组分(a)和至少一种附加生物学活性化合物或试剂的组合物，所述生物学活性化合物或试剂选自上表 D1 中所列的无脊椎害虫控制剂。

[0687] 本发明的组合物可用作植物病害控制剂。因此，本发明还包括用于控制由植物病原真菌引起的植物病害的方法，所述方法包括向要保护的植物或其部分或向要保护的植物种子或无性繁殖单元施用有效量的本发明组合物(如包含组分(a)或组分(a)和(b)的组合

物)。本发明的该方面还被描述为保护植物或植物种子免受由真菌病原体引起的病害的方法,所述方法包括向植物(或其部分)或植物种子施用杀真菌有效量的本发明组合物(直接施用到植物或植物种子上,或通过环境(例如生长介质)施用)。

[0688] 植物病害控制通常通过向欲被保护的植物的一部分,如根、杆、叶、果实、种子、块茎或鳞茎,或向其中欲被保护的植物正在生长的培养基(土壤或沙土),在感染前或感染后,施用有效量的本发明组合物(如,包含组分(a)或组分(a)和(b)的混合物),通常作为配制的组合物来完成。组分(a)或其混合物还可被施用到种子以保护所述种子和由所述种子成长的秧苗。还可通过灌溉水来施用所述混合物,以处理植物。

[0689] 组分(a)(即,至少一种化合物,所述化合物选自式 1 的化合物、其 N- 氧化物和其盐)适宜的施用量(如,杀真菌有效量的),以及对于包含根据本发明组分(a)的混合物和组合物适宜的施用量(如生物学有效量的、杀真菌有效量的或杀虫有效量的)可受许多环境因素影响并应根据实际的使用条件确定。当以小于约 1g/ha 至约 5,000g/ha 活性成分的施用量处理时,叶子通常可受到保护。当以约 0.1g 至约 10g 每千克种子的施用量处理种子时,种子和秧苗通常可受到保护;并且当繁殖单元以约 0.1 至约 10g 每千克繁殖单元的量被处理时,植物的繁殖单元(如插条和块茎)可通常被保护。本领域的技术员可通过简单的实验容易地确定提供植物保护和植物病害以及任选地其它植物害虫控制所期望的范围所需的,包含根据本发明的活性成分的具体组合的组分(a)及其混合物和组合物的施用量。

[0690] 式 1 的化合物、其 N- 氧化物及其盐尤其有效用于控制由真菌病原体,尤其是担子菌纲和子囊菌纲引起的植物病害。混合这些化合物与其它杀真菌化合物可提供控制由担子菌纲、子囊菌纲、卵菌纲和半知菌纲广谱真菌植物病原体引起的病害。因此,本文所述的混合物和组合物可控制广谱植物病害、作物叶病原体,包括:谷类作物,诸如小麦、大麦、燕麦、裸麦、黑小麦、水稻、玉米、高粱和小米;蔓生作物,诸如鲜食葡萄和酿酒葡萄;大田作物,诸如油菜(卡诺拉)、向日葵;糖用甜菜、甘蔗、大豆、花生(落花生)、烟草属植物、苜蓿草、三叶草、胡枝子、车轴草和野豌豆;仁果类水果,诸如苹果、梨、野苹果、枇杷、山楂和温柏;核果类水果,诸如桃子、樱桃、李子、杏、蜜桃和杏仁;柑橘类水果,诸如柠檬、酸橙、橙、柚子、中国柑桔(橘子)和金橘;根和块茎蔬菜和大田作物(以及它们的叶),诸如洋蓟、根甜菜和糖用甜菜、胡萝卜、木薯、姜、人参、山葵、欧洲防风草、马铃薯、白萝卜、芜菁甘蓝、甘薯、芜菁;萝卜和薯蓣;鳞茎蔬菜,诸如大蒜、韭葱、洋葱和葱;叶菜,诸如芥子苦菜(芝麻菜)、芹菜、芹菜、水芹、菊苣(茅菜)、茴香、莴苣头和莴苣叶、欧芹、红菊苣(红菊苣)、大黄、菠菜和唐莴苣;芸苔属(高丽菜)叶菜,诸如西兰花、花椰菜(西兰花)、芽甘蓝、卷心菜、白菜、菜花、甘蓝、羽衣甘蓝、大头菜、芥菜和绿叶蔬菜;豆类蔬菜(多汁的或无汁的),诸如羽扇豆、菜豆(菜豆属)(包括蚕豆、四季豆、利马豆、菜豆、花豆、红花菜豆、食荚菜豆、宽叶菜豆和黄荚种菜豆)、菜豆(Vigna 属)(包括赤豆、长豇豆、眉豆、乌豇豆、豆角、豇豆、豇豆、蛾豆、绿豆、饭豆、豇豆、黑绿豆和特长豇豆)、蚕豆(蚕豆)、鹰嘴豆(埃及豆)、瓜耳、刀豆、鹊豆、兵豆和豌豆(豌豆属)(包括四季豆、食荚豌豆、英国豆、红豌豆、豌豆、青豌豆、雪豆、甜豆、木豆和大豆);果实蔬菜,诸如茄子、地樱桃(酸浆属)、茄瓜和胡椒(包括铃状椒、红辣椒、烹饪胡椒、甘椒树、甜椒;青番茄和番茄);葫芦蔬菜,诸如佛手瓜 (果实)、冬瓜(冬瓜)、枸橼西瓜、黄瓜、嫩黄瓜、可食用葫芦(包括葫芦、西葫芦、丝瓜、和葵)、苦瓜属(包括胶苦瓜、山苦瓜、苦瓜和中国黄瓜)、香瓜(包括香瓜和南瓜)、西葫芦和笋瓜(包括胡桃南瓜、南瓜、笋瓜、小青南瓜、面条瓜)和西瓜;浆果

类，诸如黑莓(包括红果莓、波伊森莓、露莓、矮灌蓝莓、紫蓝莓、紫草梅和杨氏草莓)、蓝莓、蔓越莓、黑醋栗、接骨木莓、鹅莓、欧越莓、罗甘莓、树莓和草莓；树坚果，诸如杏仁、山毛榉树坚果、巴西果、灰胡桃、腰果、板栗、北美矮栗树果实、榛子(榛果)、山核桃树坚果、夏威夷坚果、美洲山核桃树和胡桃木；热带水果和其它作物，诸如香蕉、大蕉、芒果、椰子、木瓜、番石榴、鳄梨、荔枝、龙舌兰、咖啡、可可、甘蔗、油棕、芝麻、橡胶和香料；纤维作物，诸如棉、亚麻和大麻；草坪草(包括暖季型和凉季型草坪草)，诸如本特草、肯塔基兰草、野牛草、高羊茅和百慕大草。

[0691] 这些病原体包括：卵菌纲，包括疫霉属病原体，诸如致病疫霉、大豆疫霉病菌、柑桔脚腐病菌、樟疫霉菌和南瓜疫病菌，草腐霉枯萎属病原体，诸如瓜果腐霉菌，以及霜霉族的病原体，诸如葡萄霜霉病菌，霜霉属(包括烟草霜霉菌(Peronospora tabacina)和寄生霜霉菌(Peronospora parasitica))，假霜霉属(Pseudoperonospora)物种病害(包括黄瓜霜霉病菌(Pseudoperonospora cubensis))和盘梗霉菌病菌(Bremia lactucae)的病害；子囊菌纲，包括链格孢属病原体，诸如番茄早疫病菌和甘蓝黑斑病菌，球座菌属病原体，诸如葡萄球座菌，黑星菌属病原体，诸如苹果黑星病菌，壳针孢属病原体，诸如颖枯病菌和叶枯病菌，白粉病病害病原体，诸如布氏白粉属(包括小麦白粉病菌)和白粉菌属(包括萝白粉病菌)、葡萄白粉病菌、黄瓜白粉病菌和苹果白粉病菌、小麦基腐病菌，灰霉菌属病原体，诸如草莓灰霉病菌、桃褐腐病菌，菌核菌属病原体，诸如油菜菌核病菌、稻瘟病菌、葡萄枝枯病菌，蠕形菌属病原体，诸如玉米大斑病菌、网纹病菌，炭疽病害病原体，诸如黑果病菌或刺盘孢属(如粱炭疽病菌(Colletotrichum graminicola)和西瓜炭疽病菌(Colletotrichum orbiculare)，和小麦全蚀病菌(Gaeumannomyces graminis)；担子菌，包括由锈菌属(Puccinia)物种造成的锈菌病害(诸如隐匿柄锈菌(Puccinia recondita)、条锈菌(Puccinia striiformis)、叶锈菌(Puccinia hordei)、杆锈菌(Puccinia graminis)和柄锈菌(Puccinia arachidis))，咖啡锈菌(Hemileia vastatrix)和大豆锈菌(Phakopsora pachyrhizi)；其它病原体包括丝核菌属(Rhizoctonia spp.)物种(诸如立枯丝核菌和赤色菌核病菌)；镰孢属病原体，诸如粉红镰孢菌、禾谷镰孢菌和尖孢镰孢菌；大丽轮枝菌(Verticillium dahliae)；白绢菌(Sclerotium rolfsii)；云纹菌(Rynchosporium secalis)；黑涩病菌(Cercosporidium personatum)、黑斑病菌(Cercospora arachidicola)和褐斑病菌(Cercospora beticola)；核盘菌(Rutstroemia floccosum)(还被称为币斑菌(Sclerontina homoeocarpa)；以及其它与这些病原体密切相关的类别和菌种。一般地，病原体被称为病害，并因此在前述的语句中，词“病原体”还指的是由病原体引起的植物病害。更精确地，植物病害由病原体引起。因此例如，白粉病为由白粉病病原体引起的植物病害，壳针孢属病害为由壳针孢属病原体引起的植物病害，并且锈蜱病害为由锈蜱病害病原体引起的植物病害。某些杀真菌化合物还为杀菌的，并因此除它们的杀真菌活性以外，所述组合物或组合还可具有对抗细菌，诸如梨火疫病菌、野油菜黄单胞菌、丁香假单胞菌和其它相关菌种的活性。

[0692] 显著地，如今已被发现其中 R^2 为 H 的式 1 的 2,6- 取代的苯胺 - 吡唑化合物(即式 1，其中 X 为 NH，并且 R^1 和 R^3 不是 H)，相比于其中 R^2 不是 H 的对应的化合物具有显著改善的药代动力学特性。具体地，在脊椎动物中，已发现其中 R^2 为 H 而不是不是 H 的化合物具有分配进入脂肪显著地减少，从而降低生物累积的可能性。其中 R^2 为 H 的式 1 的例证性的

2,6-取代的苯胺-吡唑化合物为在索引表A中认定的化合物239、240、241、244、245、247、252、253、254、257、258、259、260、261、262、263、264、265、266、267、268、269、270、271、273、275和276。此外，除在脊椎动物中具有更有利的药代动力学特性以外，已发现其中R^1为卤素，或更具体地为Cl或Br，并且R^3为F或Cl，或更具体地为F的式1的2,6-取代的苯氨基-吡唑化合物，当R^2为H时，对抗植物真菌病害，诸如由叶枯病菌引起的，保持显著高的活性。

[0693] 式1化合物的药代动力学特性可使用药物学科学中已知的各种各样的测定规程来测量。在涉及单一的口服剂量的一个例证性的方法中，三只雄 性和三只雌性大鼠经由口腔给药强饲法接纳测检物。在即将给药之前，然后在0.25、0.5、1、2、4、8、12、24h以及其后每24h直至死亡，经由尾部血管收集大约0.25mL的血液。在死亡时，还收集脂肪以确定死亡时所述脂肪：血浆比率。将血液收集至包含乙二胺四乙酸(EDTA)的管子中，并以2500×g离心以便从血球中分离血浆。然后使用例如乙腈和蛋白质沉淀板(如，Strata Impact蛋白质沉淀板，Phenomenex，Torrance，CA，U.S.A.的产品型号CEO-7565)遵循板提供的用法说明书，通过蛋白质沉淀萃取所述血浆。作为另外一种选择，血浆仅用乙腈萃取，涡旋(即，使用涡旋混合器混合)并离心以使蛋白质成粒状。在移除蛋白质以后，通过液相色谱法-质谱仪(LC/MS)分析血浆关于母体化合物和/或代谢物。脂肪通过有机溶剂，诸如乙腈均匀化并萃取。然后通过LC/MS分析提取物关于母体化合物和/或代谢物。然后使用非线性模型软件如得自Pharsight，Cary，NC，U.S.A.的WinNonlin™)分析血浆药代动力学数据以确定在血浆中所给药的化合物的半衰期，在给药后，当达到最高血浆浓度(T_{max})时的时间，最高血浆浓度(C_{max})以及血浆浓度曲线下的面积(AUC)。因为脂肪的分析需要大鼠死亡，脂肪数据以单个时间点获得(即大鼠死亡的时间)。然而，通过使用在喂药时间的不同的间隔后多个大鼠死亡，确定对于大鼠的此类参数作为C_{max}。使用上述方法，发现在索引表A中认定的化合物239、240和241相比于其中R^2不是H的对应的化合物，具有分配进入脂肪显著地减少。

[0694] 在本杀真菌组合物中，式1组分(a)的化合物可与附加的组分(b)杀真菌化合物协同地起作用，以提供诸如以下的有益效果：扩展所控制的植物病害范围、延伸预防性和治疗性保护的持续时间以及抑制耐碱真菌病原体的增殖。在特定实施例中，提供了根据本发明的组合物，所述组合物包含成比例的组分(a)和组分(b)，尤其可用于控制具体的真菌病害(诸如番茄早疫病菌、小麦白粉病菌、草莓灰霉病菌、小麦叶锈病菌、立枯丝核菌、颖枯病菌、叶枯病菌)。

[0695] 与基于单独组分活性预期的相比，杀真菌剂混合物还可提供明显更好的病害控制度。此协同作用被描述为“混合物中两种组分的协同作用可使总效果比单独作用的两种(或多种)组分效果之和更大或更持久”(参见 P.M.L.Tames，Neth.J.Plant Pathology1964，70，73-80)。在其中协同由施用到植物或种子的活性成分(如，杀真菌化合物)表现出的，提供植物病害控制的方法中，所述活性成分以协同重量比和协同(即协同有效的)量施用。病害控制、抑制和预防的量度不会超过100%。因此，基本的协同作用的表达通常需要使用活性成分的施用量，其中所述活性成分单独地提供远小于100%的效果，以便它们的累加效应基本上小于100%以使作为协同作用的结果在效果上增加的可能性。在另一方面，活性成分太低的施用量在混合物中不会显示很多活性，即使有协同作用的有益效果。本领域的技术

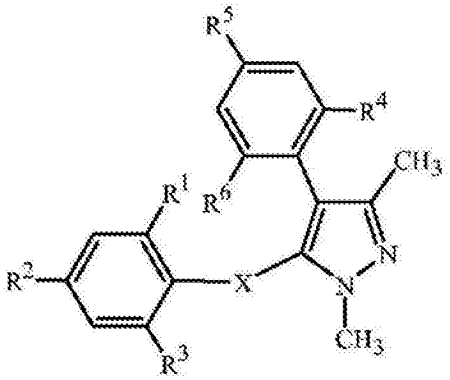
员通过简单的实验可容易地鉴定并优化提供协同作用的杀真菌化合物的重量比和施用量(即,量)。

[0696] 以下测试包括测试证明本发明化合物用于控制具体的病原体的功效;因此向包含本发明化合物的杀真菌混合物提供该功效。以下测试也包括测试证明本发明的混合物在具体的病原体上的控制功效。然而,由本发明化合物单独或以混合物提供的病害控制不限制于所例证的病原菌菌种。

[0697] 化合物的描述参见索引表A。参见关于熔点数据的索引表B。参见关于^{1}H NMR数据的索引表C。在随后的索引表中使用以下缩写:Me为甲基,MeO为甲氧基,EtO为乙氧基,并且-CN为氰基。由于对称性,R^1可与R^3相互交换,并且R^4可与R^6相互交换,如果R^1、R^3、R^4和R^6的定义允许的话。缩写“Cmpd.”代表“化合物”,并且缩写“Ex.”代表“实例”,并且后面跟随数字表示其中制得所述化合物的合成实例。质谱(M.S.)作为通过向所述分子加成H^+(分子量为1)所形成的最高同位素丰度母离子(M+1)的分子量报道,使用大气压化学电离(AP^+)通过质谱仪观察。未报道包含一个或多个较低丰度的较高原子量同位素(如^{37}Cl、^{81}Br)的分子离子的存在。

[0698] 索引表A

[0699]



[0700]

Cmpd No.	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	X	M.S.
1	F	H	H	Cl	F	H	NH	334
2	F	F	H	Cl	F	H	NH	352
3（实例 1）	F	MeO	F	Cl	F	H	NH	**
4	F	F	F	Cl	F	H	NH	370
5	F	MeO	H	Cl	F	H	O	365
6	F	F	H	F	MeO	F	NH	366
7（实例 2）	F	F	F	F	MeO	F	NH	**
8（实例 6）	F	-CN	F	F	F	F	O	**
9	Cl	Cl	H	F	F	F	O	387
10	Cl	Cl	H	F	MeO	F	O	399
11	F	F	F	F	F	H	NH	354
12	F	MeO	F	F	F	H	NH	366
13（实例 3）	F	-CN	F	Cl	F	H	O	**
14	F	-CN	F	F	MeO	H	O	374
15	F	Cl	F	F	MeO	F	O	***
16	F	MeO	F	Cl	Cl	H	NH	398
17（实例 4）	F	F	H	Cl	Cl	H	NH	**
18	F	F	F	Cl	Cl	H	NH	386
19	F	MeO	F	F	F	F	NH	384
20	F	-CN	F	F	MeO	F	NH	391
21	F	MeO	F	F	MeO	F	NH	396
22	F	H	F	F	MeO	F	O	367
23	Cl	F	H	F	MeO	F	NH	382
24	F	Br	F	F	MeO	F	O	447
25	F	-CN	F	Cl	F	H	NH	377
26	F	-CN	F	F	F	F	NH	379
27	F	-CN	H	F	F	F	O	362
28	Cl	-CN	H	F	F	F	O	378

[0701]

Cmpd No.	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	X	M.S.
29	F	F	F	Cl	MeO	H	NH	382
30	F	F	H	F	-CN	F	NH	361
31	Cl	F	H	F	-CN	F	NH	*
32	Cl	-CN	H	F	MeO	F	NH	389
33	F	-CN	H	Cl	F	H	O	360
34	F	-CN	H	F	F	F	NH	361
35	F	F	F	F	-CN	F	NH	*
36	F	MeO	F	F	-CN	F	NH	*
37	Cl	-CN	H	Cl	F	H	O	376
38	F	-CN	F	F	MeO	F	O	392
39	F	F	H	F	EtO	F	NH	380
40	F	Cl	H	F	-CN	F	NH	*
41	F	-CN	F	Cl	MeO	H	O	390
42	F	F	H	Cl	MeO	H	NH	364
43	F	H	F	Cl	MeO	H	NH	364
44	Cl	-CN	H	Cl	F	H	NH	375
45	F	-CN	F	F	F	H	O	362
46	F	H	F	Cl	F	H	NH	352
47	Cl	F	H	Cl	F	H	NH	368
48	F	F	H	Cl	H	F	NH	352
49	F	F	H	F	H	F	NH	*
50	Cl	Cl	H	F	H	F	NH	*
51	F	MeO	H	F	H	F	NH	*
52	F	F	H	F	H	H	NH	318
53	F	F	F	F	H	H	NH	336
54	F	MeO	F	F	H	H	NH	348
55	F	MeO	F	Cl	H	F	NH	382
56	F	F	F	Cl	H	F	NH	369
57	F	-CN	F	Cl	H	F	NH	377
58	Cl	F	H	Cl	H	F	NH	368
59	F	-CN	H	F	H	F	NH	343
60	Cl	MeO	H	F	H	F	NH	*
61	Cl	F	H	F	F	H	NH	*
62	F	F	H	F	MeO	F	CHOH	381
63	F	MeO	H	F	F	H	NH	*

[0702]

Cmpd No.	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	X	M.S.
64	F	F	H	F	F	H	NH	336
65	F	-CN	F	Br	F	H	O	423
66	Cl	MeO	H	F	F	H	NH	*
67	Cl	Cl	H	F	F	H	NH	*
68	F	-CN	H	F	F	H	NH	*
69	F	H	F	F	H	F	NH	*
70	F	F	F	Br	H	H	NH	398
71	F	H	F	F	F	H	NH	*
72	F	MeO	F	F	H	F	NH	*
73	Br	F	H	Cl	F	H	NH	413
74	F	F	F	Br	F	H	NH	415
75	F	-CN	F	Cl	H	H	O	*
76	F	-CN	F	Br	H	H	O	*
77	Cl	Cl	H	Cl	MeO	H	NH	397
78	Cl	Cl	H	Cl	H	F	NH	386
79	F	-CN	H	Br	F	H	O	406
80	Cl	-CN	H	Br	F	H	O	422
81	F	Cl	F	Cl	F	H	NH	386
82	Cl	F	F	Cl	F	H	NH	386
83	F	-CN	F	F	F	H	NH	*
84	Cl	F	F	Br	F	H	NH	431
85	Cl	MeO	Cl	Cl	F	H	NH	413
86	Cl	F	F	F	H	F	NH	370
87	Cl	F	F	Cl	H	F	NH	386
88	Cl	Cl	H	Cl	F	H	NH	383
89	F	F	F	F	H	F	NH	*
90	F	-CN	F	F	H	F	NH	*
91	F	-CN	F	F	H	H	O	*
92	F	-CN	H	Cl	MeO	H	O	372
93	Cl	-CN	H	Cl	MeO	H	O	388
94	F	F	H	Br	F	H	NH	398
95	Br	F	H	Br	F	H	NH	458
96	Cl	F	H	Br	F	H	NH	414
97	F	F	H	Cl	H	H	NH	334
98	Cl	F	Cl	Br	F	H	NH	448

[0703]

Cmpd No.	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	X	M.S.
99	Cl	-CN	H	Br	MeO	H	O	433
100	F	-CN	H	Br	MeO	H	O	418
101	Cl	MeO	H	Cl	F	H	NH	380
102	Cl	MeO	Cl	Br	F	H	NH	459
103	Cl	MeO	H	Br	F	H	NH	425
104	Cl	EtO	H	Cl	F	H	NH	394
105	Cl	Cl	H	Cl	H	Cl	NH	*
106	F	-CN	F	Cl	F	F	NH	395
107	F	F	H	Cl	-CN	H	NH	359
108	Cl	F	F	Cl	-CN	H	NH	393
109	Cl	F	H	Cl	H	Cl	NH	*
110	F	H	F	Cl	-CN	H	NH	359
111	F	Cl	F	Cl	-CN	H	NH	393
112	Cl	F	H	Cl	-CN	H	NH	375
113	F	F	H	Cl	H	Cl	NH	*
114	Br	F	H	Cl	H	Cl	NH	*
115	Cl	F	Cl	Cl	H	Cl	NH	*
116	F	-CN	H	Cl	H	F	O	360
117	Cl	F	F	F	F	H	NH	369
118	Br	F	H	F	F	H	NH	398
119	F	-CN	H	F	Cl	H	O	360
120	Br	F	Cl	F	F	H	NH	432
121	F	Cl	F	F	H	F	NH	370
122（实例 5）	F	F	H	Cl	F	H	CHOH	**
123	Cl	F	H	Cl	F	H	CHOH	383
124	F	H	F	Cl	Cl	H	NH	*
125	Cl	F	H	Cl	Cl	H	NH	*
126	F	Cl	F	F	F	H	NH	370
127	Cl	-CN	H	F	H	F	O	360
128	F	-CN	H	F	F	H	O	376
129	F	Cl	F	Br	F	H	NH	432
130	F	-CN	H	F	H	F	O	344
131	Cl	-CN	H	Cl	Cl	H	O	394
132	Cl	F	Cl	Cl	Cl	H	NH	*
133	F	Br	F	F	F	H	NH	416

[0704]

Cmpd No.	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	X	M.S.
134	F	Br	F	Cl	F	H	NH	432
135	F	Br	H	Cl	F	H	NH	414
136	Cl	Cl	F	Cl	F	H	NH	402
137	Cl	F	Cl	F	F	H	NH	386
138	Cl	F	Cl	Cl	F	H	NH	404
139	Br	-CN	H	F	F	H	O	406
140	Cl	-CN	H	F	F	H	O	360
141	Cl	Cl	F	F	F	H	NH	386
142	Cl	F	Cl	F	H	F	NH	386
143	Br	F	F	F	F	H	NH	416
144	Br	F	F	Cl	F	H	NH	432
145	F	Br	F	F	H	F	NH	416
146	Br	F	F	F	H	F	NH	416
147	Br	F	F	Cl	H	F	NH	
148	F	Cl	F	Cl	F	H	CHOH	401‡
150	F	Cl	F	F	-CN	H	NH	377
151	Cl	F	F	Cl	F	H	CHOH	
152	Br	F	H	F	F	H	CHOH	
153	Br	F	H	Cl	F	H	CHOH	427 †
154	F	Br	H	F	F	H	NH	396
155	Cl	Br	Cl	F	F	H	NH	448
156	Cl	F	F	Cl	Cl	H	NH	*
157	F	Cl	F	Cl	Cl	H	NH	*
158	F	Cl	H	Cl	F	H	O	369
159	F	-CN	H	F	F	H	O	344
160	F	Cl	H	F	F	H	NH	352
161	Cl	Cl	F	F	F	H	NH	386
162	F	Cl	H	F	H	F	NH	352
163	F	Br	F	Br	F	H	NH	474
164	Cl	Br	Cl	Cl	F	H	NH	464
165	Cl	Cl	Cl	F	F	H	NH	404
167	Cl	Br	H	F	F	H	NH	414
168	Cl	Br	Cl	Br	F	H	NH	508
169	F	Br	H	Br	F	H	NH	458
170	Cl	Cl	Cl	Cl	F	H	NH	420

[0705]

Cmpd No.	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	X	M.S.
172	Cl	Br	H	Cl	F	H	NH	430
173	Cl	Br	H	Br	F	H	NH	474
174	Cl	Cl	Cl	Br	F	H	NH	464
175	I	F	H	F	F	H	NH	444
177	F	Cl	H	Cl	F	H	CHOH	384
178	F	F	F	Cl	F	H	CHOH	385
179	F	-CN	H	Cl	F	H	CHOH	374
180	F	Cl	I	F	F	H	NH	478
181	I	F	H	Cl	F	H	NH	460
182	F	Cl	I	Cl	F	H	NH	494
183	Br	Br	H	Cl	F	H	NH	474
184	Br	Br	H	F	F	H	NH	458
185	F	Cl	F	F	MeO	H	NH	382
186	F	Cl	Br	Cl	F	H	NH	448
187	F	F	Cl	F	MeO	H	NH	396
188	F	F	Cl	F	EtO	H	NH	396
189	F	Cl	F	F	EtO	H	NH	396
190	F	Cl	Cl	F	EtO	H	NH	412
191	F	Cl	Cl	F	MeO	H	NH	398
192	Cl	F	Cl	F	EtO	H	NH	412
193	F	F	H	F	EtO	H	NH	***
194	Cl	F	Cl	F	MeO	H	NH	398
195	Br	F	F	Br	F	H	NH	476
196	F	F	Cl	F	EtO	F	NH	414
197	Cl	Cl	I	Cl	F	H	NH	512
198	Cl	Cl	F	F	EtO	F	NH	430
199	F	Cl	F	F	EtO	F	NH	414
200	Cl	F	Cl	F	EtO	F	NH	430
201	F	Cl	Cl	Cl	MeO	H	NH	416
202	F	Cl	Cl	Cl	EtO	H	NH	430
203	F	F	Cl	Cl	MeO	H	NH	398
204	F	Cl	F	Cl	MeO	H	NH	398
205	Cl	F	Cl	Cl	MeO	H	NH	416
206	F	F	Cl	Cl	EtO	H	NH	412
207	F	Cl	F	Cl	EtO	H	NH	412

[0706]

Cmpd No.	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	X	M.S.
208	Cl	F	Cl	Cl	EtO	H	NH	430
209	F	F	H	Cl	EtO	H	NH	378
210	Cl	Cl	I	F	F	H	NH	494
211	Br	Br	F	F	F	H	NH	476
212	Br	Br	F	Cl	F	H	NH	492
213	F	F	I	Cl	F	H	NH	478
214	F	F	I	F	F	H	NH	462
215	F	F	I	Br	F	H	NH	524
216	F	I	F	F	F	H	NH	462
217	F	I	F	Cl	F	H	NH	478
218	F	I	F	Br	F	H	NH	524
219	I	F	F	Cl	MeO	H	NH	490
220	F	I	F	Cl	MeO	H	NH	490
221	F	F	Br	Cl	MeO	H	NH	444
222	Cl	Cl	F	I	F	H	NH	494
223	Br	Br	F	I	F	H	NH	584
224	F	Cl	F	Cl	MeO	H	CHOH	413
225	F	Cl	F	I	F	H	NH	478
226	Br	F	F	I	F	H	NH	524
227	Cl	F	Cl	F	Cl	H	NH	*
228	Cl	F	F	F	Cl	H	NH	*
229	Br	F	F	F	Cl	H	NH	*
230	F	Cl	F	F	Cl	H	NH	*
231	F	Cl	Cl	F	Cl	H	NH	*
232	Cl	F	H	F	Br	H	NH	*
233	Cl	F	Cl	F	Br	H	NH	*
234	Cl	F	F	F	Br	H	NH	*
235	Br	F	F	F	Br	H	NH	*
236	F	Cl	F	F	Br	H	NH	*
237	F	Cl	Cl	F	Br	H	NH	*
238	Cl	F	F	F	-CN	H	NH	*
239	Cl	H	F	Cl	F	H	NH	*
240（实例 7）	Cl	H	F	Br	F	H	NH	414
241	Br	H	F	Cl	F	H	NH	414
242	Br	H	H	Br	F	H	NH	440

[0707]

Cmpd No.	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	X	M.S.
243	I	H	H	Br	F	H	NH	488
244	Br	H	F	Br	F	H	NH	*
245	Br	H	F	F	F	H	NH	*
246	I	H	H	F	F	H	NH	426
247	Br	H	F	F	H	F	NH	*
248	Cl	F	H	F	-CN	H	NH	***
249	Cl	F	Cl	F	-CN	H	NH	*
250	-CN	F	F	F	-CN	H	NH	*
251	Cl	H	Cl	F	F	H	NH	367
252	Me	H	F	Cl	F	H	NH	348
253	Me	H	Cl	Cl	F	H	NH	364
254	Me	H	Br	Cl	F	H	NH	410
255	Cl	H	Cl	Cl	F	H	NH	*
256	Cl	H	Cl	Br	F	H	NH	*
257	Me	H	Cl	F	MeO	H	NH	360
258	Me	H	Br	F	MeO	H	NH	406
259	Me	H	F	F	MeO	H	NH	344
260	Cl	H	F	F	MeO	H	NH	364
261	Br	H	F	F	MeO	H	NH	410
262	Me	H	Cl	Cl	MeO	H	NH	376
263	Me	H	Br	Cl	MeO	H	NH	422
264	Cl	H	F	Cl	MeO	H	NH	380
265	Me	H	Br	F	F	H	NH	394
266	Me	H	Br	Br	F	H	NH	454
267	Me	H	F	Br	F	H	NH	394
268	Me	H	F	F	F	H	NH	332
269	Me	H	Cl	F	F	H	NH	348
270	Me	H	Me	F	F	H	NH	328
271	Me	H	Me	Cl	F	H	NH	344
272	Cl	H	H	Br	F	H	NH	396
273	Br	H	F	Cl	MeO	H	NH	426
274	Br	H	H	Cl	F	H	NH	396
275	Cl	H	F	F	F	H	NH	352
276	Me	H	Cl	Br	F	H	NH	410

[0708] * 熔点(MP)数据列于索引表 B 中。

[0709] **AP^+ 数据或 ^1H NMR 数据列于合成实例中。

[0710] ***^1H NMR 数据列于索引表 C 中。

[0711] 观测†母离子(M),非 M+1 峰值。

[0712] 还观测‡ 402 (M+2)峰值。

[0713] 索引表 B

[0714]

Cmpd No.	熔点[a]	Cmpd No.	熔点	Cmpd No.	熔点
31	80–82	72	172–174	156	181–183
35	160–162	75	132–135	157	155–157
36	228–230	76	132–134	227	183–184
40	93–95	83	181–183	228	180–182
49	110–112	89	178–180	229	154–155
50	105–107	90	168–170	230	190–191
51	130–132	91	101–105	231	154–155
60	109–111	114	137–139	238	177–179
61	57–59	115	151–153	239	166–168
63	133–135	124	169–171	244	154–156
66	91–93	125	111–113	245	149–151
67	82–84	132	229–231	247	127–129
68	182–184	232	88–89	249	200–202
69	156–158	233	186–187	250	200–202
71	171–173	234	182–183	255	183–185
105	118–120	235	167–169	256	199–201
109	117–119	236	199–201		
113	135–136	237	160–162		

[0715] a 熔点数据为℃。

[0716] 索引表 C

[0717]

Cmpd No.	^{1}H NMR 数据($CDCl_3$ 溶液,除非另外指明)[a]
15	δ 6.74 (m, 2H), 6.30 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 2.03 (s, 3H)。
193	δ 7.01 (m, 1 H) 6.79 (ddd, 1H) 6.63 (m, 3 H) 6.34 (td, 1H) 5.34 (br s, 1H) 3.99 (m, 2H) 3.68 (s, 3H) 2.23 (s, 3H) 1.39 (m, 3H)。

[0718]

248	δ 7.30 (m, 2H), 7.25-7.30 (m, 1H), 7.08 (m, 1H), 6.76 (m, 1H), 6.28 (m, 1H), 5.67 (br s, 1H), 3.69 (s, 3H), 2.27 (s, 3H)。

[0719] a^{1}H NMR 数据以距四甲基硅烷的低场 ppm 数为单位。偶合被称为(s)-单峰,(br s)-宽的单峰,(ddd)-双双二重峰,(td)-三重双峰以及(m)-多峰。

[0720] 本发明的生物学实例

[0721] 制备测试 A-I 中测试悬浮液的一般方案:首先将测试化合物溶解于量等于最终体积 3% 的丙酮中,然后以适当的浓度(以 ppm 为单位)悬浮在丙酮和纯化水(按体积 50/50 混合)中,所述纯化水包含的表面活性剂 Trem® 250014 (多元醇酯)。于是所得的测试悬浮液在测试 A-I 中使用。每个测试以一式三份进行,并且平均所述结果。在测试植物上喷洒

200ppm测试悬浮液至流失点，等同于约800g/ha的施用量。除非另外指明，使用表示200ppm测试悬浮液的评定值。使用紧邻评定值的星号“*”表示40ppm测试悬浮液。

[0722] 测试A

[0723] 在番茄秧苗上喷洒测试悬浮液至流失点。第二天，用草莓灰霉病菌(Botrytis cinerea)(番茄灰霉病的致病原)的孢子悬浮液感染所述秧苗，并且在20℃的饱和氛中培养48h，然后转移到24℃的生长室中再培养3天，其后进行目视病害评定。

[0724] 测试B

[0725] 在番茄秧苗上喷洒测试悬浮液至流失点。第二天，用番茄早疫病菌(Alternaria solani)(番茄早疫病的致病原)的孢子悬浮液感染所述秧苗，并且在27℃的饱和氛中培养48h，然后转移到20℃的生长室中培养5天，其后进行目视病害评定。

[0726] 测试C

[0727] 在番茄秧苗上喷洒测试悬浮液至流失点。第二天，用马铃薯晚疫病菌(番茄晚期枯萎病的致病原)孢子悬浮液感染所述秧苗，并且在20℃的饱和气氛中培养24h，然后移入20℃的生长室中保持5天，其后进行目视病害评定。

[0728] 测试D

[0729] 在匍匐翦股颖秧苗(Agrostis sp.)上喷洒测试悬浮液至流失点。第二天，用赤色菌核病菌(Rhizoctonia solani)(草皮褐斑病的致病原)的麸皮和菌丝体浆液感染所述秧苗，并且在27℃的饱和氛中培养48h，然后转移到27℃的生长室中培养3天，其后进行目视病害评定。

[0730] 测试E

[0731] 在小麦秧苗上喷洒测试悬浮液至流失点。第二天，用颖枯病菌(Septoria nodorum)(壳针孢属颖斑病的致病原)的孢子悬浮液感染所述幼苗，并且在24℃的饱和氛中培养48h，然后转移到20℃的生长室中培养9天，其后进行目视病害评定。

[0732] 测试F

[0733] 在小麦秧苗上喷洒测试悬浮液至流失点。第二天，用叶枯病菌(Septoria tritici)(小麦叶斑枯病致病原)的孢子悬浮液感染所述秧苗，并且在24℃的饱和氛中培养48h，然后所述秧苗被转移到20℃的生长室中再培养19天，其后进行目视病害评定。

[0734] 测试G

[0735] 用隐匿柄锈菌(Puccinia recondita f.sp.tritici)(小麦叶锈病的致病原)的孢子悬浮液感染小麦秧苗，并且在20℃的饱和氛中培养24h，然后转移到20℃的生长室中培养2天。在短时间干燥后，用测试悬浮液喷雾至流失点，然后将所述秧苗移入20℃生长室中培养4天，其后进行目视病害评定。

[0736] 测试H

[0737] 在小麦秧苗上喷洒测试悬浮液至流失点。第二天，用隐匿柄锈菌(Puccinia recondita f.sp.tritici)(小麦叶锈病的致病原)的孢子悬浮液感染所述秧苗，并且在20℃的饱和氛中培养24h，然后转移到20℃的生长室中培养6天，其后进行目视病害评定。

[0738] 测试I

[0739] 在小麦秧苗上喷洒测试悬浮液至流失点。第二天，用小麦白粉病菌(还已知为小麦白粉病菌，小麦白粉病的致病原)的孢子粉剂感染所述秧苗，并且在20℃的生长室中培养8

天，其后进行目视病害评定。

[0740] 测试 A-I 的结果示于表 A 中。在表中，等级 100 表示 100% 的病害防治，而等级 0 表示无病害防治(相对于对照物)。连字符(-)表示无测试结果。

[0741] 表 A

[0742]

Cmpd No.	测试 A	测试 B	测试 C	测试 D	测试 E	测试 F	测试 G	测试 H	测试 I
1	99	93	0	99	0	100	-	99	100
2	99	100	0	98	64	100	-	100	99
3	100	100	-	-	93	97	96	100	100
4	99	100	-	-	99	95	99	100	100
5	98	100	-	-	97	97*	-	100	99
6	98	100	-	-	99	93	92	100	100
7	98	100	-	-	0	94	9	97	100
8	99*	98*	-	-	0*	47*	15*	79*	60*
9	99	9	-	-	0	97	0	99	99
10	99	0	-	-	0	94	92	99	99
11	100	99	-	-	90	94	0	100	99
12	100	0	-	-	0	93	0	94	82
13	100	100	-	-	100	100	7	100	100
14	99	100	-	-	99	100	37	100	99
15	98	100	-	-	89	98	82	100	100
16	99	98	-	-	84	98	98	99	99
17	100	73	-	-	60	99	91	99	100
18	100	98	-	-	98	99	95	99	97
19	99	82	-	-	0	98	0	89	91
20	100	100	-	-	40	99	0	68	13
21	100	100	-	-	89	99	99	96	94
22	100	100	-	-	78	100	98	100	99
23	100	100	-	-	95	98	85	99	100
24	99	95	-	-	84	100	0	98	100
25	100	99	-	-	95	99	0	100	100
26	100	100	-	-	99	100	41	99	100
27	99	99	-	-	99	100	9	99	100
28	100	17	-	-	69	100	26	99	99
29	100	99	-	-	97	99	99	99	100
30	100	99	-	-	90	100	82	99	100
31	100	98	-	-	99	99	53	100	100
32	99	97	-	-	82	100	11	98	97
33	100	100	-	-	98	100	99	100	99
34	100	99	9	-	94	100	0	99	99
35	100	100	-	-	60	99	0	100	94
36	99	0	-	-	0	99	0	41	0
37	100	86	-	-	100	100	69	99	100
38	99	94	-	-	87	99	0	96	97

[0743]

Cmpd No.	测试 A	测试 B	测试 C	测试 D	测试 E	测试 F	测试 G	测试 H	测试 I
39	99	99	-	-	98	100	0	99	100
40	99	99	-	-	100	100	63	100	100
41	100	99	-	-	100	100	92	100	99
42	98	99	-	-	0	99	8	100	100
43	98	100	-	-	0	100	95	100	98
44	99	0	-	-	0	99	8	98	94
45	100	99	0	-	99	98	0	100	99
46	100	100	-	-	87	100	0	99	100
47	100	99	0	-	82	96	93	99	100
48	100	100	-	-	73	98	0	83	100
49	100	100	-	-	80	98	0	83	100
50	100	99	-	-	73	95	0	93	100
51	100	99	-	-	0	98	0	68	100
52	94	44	-	-	0	100	0	60	98
53	97	99	-	-	87	100	0	95	99
54	97	100	-	-	67	99	27	94	99
55	99	99	-	-	80	100	94	100	99
56	98	100	-	-	0	100	0	97	99
57	97	100	-	-	73	100	0	99	99
58	99	100	-	-	0	100	32	99	100
59	99	94	0	-	73	100	9	98	98
60	99	97	-	-	20	100	18	97	99
61	100	93	-	-	64	100	0	99	100
62	100	100	-	-	99	100	0	99	99
63	99	99	-	-	0	99	0	80	99
64	99	99	-	-	0	100	0	97	100
65	100	99	-	-	99	100	0	100	100
66	99	37	-	-	0	100	0	91	100
67	100	64	-	-	0	100	0	97	100
68	99	51	-	-	0	100	0	80	100
69	100	99	-	-	60	100	0	99	100
70	99	26	-	-	73	100	0	99	100
71	99	99	-	-	96	100	0	99	100
72	100	99	-	-	0	100	0	97	98
73	100	99	-	-	78	100	90	100	100
74	100	100	-	-	98	100	0	100	100
75	100	99	-	-	99	100	0	99	98
76	100	97	-	-	99	99	0	99	99
77	99	98	-	-	0	99*	0	99	100
78	99	65	-	-	0	99*	9	99	100
79	99	99	-	-	100	100*	28	100	100
80	98	0	-	-	60	100*	9	99	99
81	100	99	0	-	90	100	99	100	100
82	99	100	0	-	100	100	97	100	100
83	100	99	-	-	87	100	0	100	100

[0744]

Cmpd No.	测试 A	测试 B	测试 C	测试 D	测试 E	测试 F	测试 G	测试 H	测试 I
84	100	99	-	-	96	100	92	100	100
85	99	0	-	-	0	100	0	99	99*
86	100	99	-	-	90	100	0	100	100
87	100	93	-	-	87	100	0	100	100
88	100	95	-	-	51	100*	41	100	100
89	100	99	-	-	82	100	9	99	100
90	99	87	-	-	87	100	0	98	99
91	99	99	-	-	94	100	0	99	99
92	100	99	-	-	99	100	0	99	96
93	100	0	-	-	60	100	0	99	91
95	100	97	-	-	51	100	91	100	100
96	100	95	-	-	0	100	94	100	100
97	99	99	-	-	0	100	0	96	100
98	99	0	-	-	0	99	9	99	96
99	99	0	-	-	0	100	0	97	89
100	92	88	-	-	100	100	0	99	95
101	100	93	-	-	0	100	99	100	100
102	98	0	-	-	0	98	0	94	95*
103	99	83	-	-	0	100	63	99	99
104	100	0	-	-	0	100	0	97	99
105	99	0	-	-	0	100	0	96	99
107	100	80	-	-	73	100	8	100	97
109	100	0	-	-	0	100	0	97	100
111	100	97	-	-	95	100	94	100	99
112	100	37	-	-	40	100	8	100	99
113	100	0	-	-	0	100	0	98	100
114	99	0	-	-	0	100	0	91	100
115	99	0	-	-	0	99	0	99	93
116	100	33	-	-	99	100	0	100	100
117	100	100	-	-	97	100	91	100	100
118	100	93	-	-	69	100	75	97	100
119	99	94	-	-	94	100	0	91	99
120	100	80	-	-	94	100	19	100	100
122	100	99	-	-	92	100	96	100	99
123	100	86	-	-	60	100	6	100	95
124	97	17	-	-	0	99	3	99	99
125	99	0	-	-	0	100	82	98	100
126	100	86	-	-	87	100	0	99	100
127	99	0	-	-	0	100	0	97	97
128	100	99	-	-	97	100	0	100	99
129	100	97	-	-	95	100	79	100	100
130	100	90	-	-	0	100	0	100	100
131	100	0	-	-	0	100	0	96	96

[0745]

Cmpd No.	测试 A	测试 B	测试 C	测试 D	测试 E	测试 F	测试 G	测试 H	测试 I
132	93（标注 1）	0	-	-	0	99	0	96	43
133	99	97	-	-	88	100	0	99	100
134	100	99	-	-	64	100	74	100	100
135	100	58	-	-	0	100	9	99	100
136	100	100	0	-	100	100	100	100	100
137	100	95	-	-	87	100	87	99	100
138	100	66	0	-	0	100	17	100	99
139	82	0	-	-	0	100	9	89	0
140	67	0	-	-	0	100	9	97	97
141	99	99	-	-	99	100	97	100	100
142	100	96	0	-	92	100	0	100	100
143	100	100	0	-	100	100	100	100	100
144	100	99	-	-	100	100	100	100	100
145	99	0	0	-	0	100	0	28	90
146	-	100	0	-	100	100	74	98	100
148	100	0	-	-	60	100	0	100	64
150	100	-	-	-	-	100	-	100	100
153	-	0	-	-	0	100	0	96	0
154	100	9	-	-	0	100	68	98	99
155	100	0	-	-	0	100	94	97	99
156	100	99	-	-	73	100	31	99	99
157	100	97	0	-	87	100	27	100	99
158	100*	80*	-	-	0*	99*	37*	98*	96*
159	100*	97*	-	-	86*	100*	0*	98*	96*
160	100	99	-	-	0	100	0	99	100
161	100	99	0	-	100	99	100	100	100
162	100	88	0	-	0	100	9	100	100
163	100*	77*	-	-	60*	100*	91*	100*	100*
164	99	0	-	-	0	100	99	100	99
165	100	0	0	-	0	100	67	99	99
167	100	0	-	-	0	100	6	92	98
168	0	0	-	-	0	100	97	91	48
169	100	0	-	-	60	100	23	96	99
170	65	0	-	-	0	100	79	98	79
172	100	73	-	-	60	100	0	100	100
173	100	0	-	-	40	100	0	99	99
174	95	0	-	-	0	100	0	99	99*
175	100	97	-	-	73	100	41	100	100
177	99	0	-	-	0	-	0	0	48
178	100	33	-	-	0	-	98	100	74
179	96	16	-	-	0	-	9	99	0
180	100	100	9	-	99	100	98	100	100
181	100	99	-	-	99	100	99	99	100

[0746]

Cmpd No.	测试 A	测试 B	测试 C	测试 D	测试 E	测试 F	测试 G	测试 H	测试 I
182	100	100	-	-	100	100	100	100	100
183	100	0	-	-	0	100	54	96	98
184	100	58	-	-	60	100	0	98	100
185	100	99	0	-	60	100	0	99	100
186	100	100	0	-	100	100	100	100	100
187	100	100	0	-	89	-	32	100	100
188	100	99	0	-	92	-	0	98	98
189	100	88	0	-	90	-	0	98	98
190	100	82	0	-	0	-	9	96	95
191	100	99	0	-	92	-	46	99	99
192	33	66	0	-	0	100	0	65	35
193	-	58	-	-	0	100	0	27	92
194	-	93	-	-	87	100	0	95	63
195	99	100	0	-	99	100	89	100	100
196	100	100	0	-	95	100	0	94	100
197	100	77	-	-	0	100	9	97	94
198	100	100	-	-	60	100	9	80	96
199	100	100	68	-	69	100	0	83	99
200	98	97	31	-	0	100	0	86	79
201	100	100	-	-	99	100	98	100	97
202	99	77	-	-	0	100	35	92	95
203	95	100	-	-	73	100	79	100	98
204	99	99	-	-	99	100	99	100	100
205	59	31	-	-	0	100	0	99	21
206	99	100	-	-	99	100	0	99	100
207	94	99	-	-	86	100	0	94	99
208	18	0	-	-	0	99	0	85	27
209	98	95	-	-	0	100	0	92	100
210	3	0	-	-	0	100	0	97	0
211	98	99	-	-	99	100	82	100	100
212	98	100	-	-	100	100	97	100	100
213	100	100	-	-	100	100	100	100	100
214	100	100	-	-	99	100	99	99	100
215	100	100	-	-	99	100	100	100	100
216	100	0	-	-	60	100	18	95	99
217	100	58	-	-	86	100	41	99	99
218	100	68	-	-	86	100	0	99	99
219	100	100	-	-	100	100	99	100	99
220	100	69	-	-	73	100	0	97	96
221	100	100	-	-	97	100	73	99	100
222	98	77	-	-	0	100	0	90	96
223	98	88	-	-	0	100	0	97	99
224	-	100	-	-	89	100	54	100	94
225	99	68	-	-	0	100	0	99	100
226	97	97	-	-	60	100	0	99	100

[0747]

Cmpd No.	测试 A	测试 B	测试 C	测试 D	测试 E	测试 F	测试 G	测试 H	测试 I
227	0	0	-	-	0	100	0	95	96
228	68	40	-	-	0	100	0	96	81
229	99	99	-	-	64	100	9	97	98
230	40	0	-	-	0	100	0	94	95
231	33	58	-	-	0	100	9	94	99
232	79	-	-	-	-	100	-	90	99
233	36	-	-	-	-	100	-	91	89
234	97	-	-	-	-	100	-	91	79
235	99	-	-	-	-	100	-	96	90
236	47	-	-	-	-	100	-	28	0
237	99	-	-	-	-	100	-	92	95
238	100	-	-	-	-	100	-	100	100
239	100	100	0	-	99	100	100	100	99
240	100	-	-	-	-	100	-	100	100
241	100	-	-	-	-	100	-	100	100
242	99*	-	-	-	-	100*	-	96*	99*
243	100	-	-	-	-	100	-	99	100
244	100	-	-	-	-	100	-	100	100
245	100	-	-	-	-	100	-	100	100
246	100	-	-	-	-	100	-	98	99
247	100	-	-	-	-	100	-	100	100
248	99	-	-	-	-	100	-	99	99
249	100	-	-	-	-	100	-	98	92
250	0	-	-	-	-	100	-	100	89
251	100	-	-	-	-	100	-	100	100
252	100	-	-	-	-	100	-	100	100
253	100	-	-	-	-	100	-	100	100
254	100	-	-	-	-	100	-	100	100
255	100*	-	-	-	-	100*	-	99*	81*
256	99*	-	-	-	-	100*	-	95*	64*
257	100*	-	-	-	31*	100*	-	63*	27*
258	100*	-	-	-	0*	100*	-	9*	0*
259	100*	-	-	-	0*	100*	-	82*	90*
260	100*	-	-	-	0*	100*	-	85*	90*
261	-	-	-	-	0*	100*	-	97*	95*
262	97*	-	-	-	0*	100*	-	85*	79*
263	99*	-	-	-	0*	100*	-	79*	13*
264	100*	-	-	-	0*	100*	-	97*	81*
265	100	-	-	-	-	100	-	99	100
266	99	-	-	-	-	100	-	99	99
267	100	-	-	-	-	100	-	100	100
268	100	-	-	-	-	100	-	99	100
269	100	-	-	-	-	100	-	99	100
270	98*	-	-	-	-	100*	-	41*	91*
271	99*	-	-	-	-	100*	-	97*	98*

[0748]

Cmpd No.	测试 A	测试 B	测试 C	测试 D	测试 E	测试 F	测试 G	测试 H	测试 I
272	100	-	-	-	-	100	-	99	100
275	100	99	0	-	60	100	9	95	100
276	100*	-	-	-	-	100*	-	99*	92*

[0749] “Cmpd No.”表示化合物编号。

[0750] 标注 1 :在早先的测试中,等级为“65”。

[0751] 测试 K、L 和 M

[0752] 对于制备测试组合物用于测试 K、L 和 M 的一般规程如下所述。化合物 81,广谱杀菌剂,5- 氯 -6-(2,4,6- 三氟苯基)-7-(4- 甲基哌啶 -1- 基)[1,2,4] 三唑并 [1,5-a] 嘧啶(BAS600)、环丙唑醇、萘吡菌胺(isopyrazam)、吡噻菌胺、烯丙异噻唑、快诺芬和螺环菌胺作为未配制的、工业级材料获得。嘧菌酯、啶酰菌胺、百菌清、氢氧化铜、霜脲氰、恶醚唑、烯酰吗啉、氟环唑、丁苯吗啉、氟啶胺、咯菌腈、灭菌丹、异菌脲、丙森锌、代森锰锌、甲霜灵(还已知为甲霜灵 -M)、腈菌唑、啶氧菌酯、丙氧喹啉、丙硫菌唑、唑菌胺酯、氟醚唑和三环唑作为分别以商标 AMISTAR、ENDURA、BRAVO、KOCIDE、CURZATE、SCORE、ACROBAT、OPUS、CORBEL、OMEGA、MAXIM、PHALTAN、ROVRAL、MELODY、MANZATE、RIDOMIL GOLD、NOVA、ACANTO、TALIUS、PROLINE、HEADLINE、DOMARK 和 BEAM 出售的配制产品获得。首先将非配方材料溶解于丙酮中,然后以所需的浓度(以 ppm 为单位)悬浮于包含 250ppm 表面活性剂Trem® 014 (多元醇酯)的丙酮和纯化水(按体积 50/50 的混合物)中。将配方材料分散于足量的水中以获得所需的浓度,并且不向所述悬浮液中加入有机溶剂和表面活性剂。然后将所得的测试混合物用于测试 K、L 和 M 中。在测试植物上喷洒 200ppm 测试悬浮液至流失点,等同于约 800g/ha 的施用量。将测试重复三次,并且将三次重复的平均值作为结果报告。

[0753] 在两种活性成分之间存在的协同效应在 Colby 公式的帮助下建立(参见 Colby, S.R. “Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations”, Weeds, (1967), 15, 20-22):

[0754] $$p = A + B - \left[\frac{A \times B}{100}\right]$$

[0755] 使用 Colby 方法,通过首先基于单独施用的两种组分的活性,计算混合物的预测活性 p 来确定两种活性成分间协同效应的存在。如果 p 小于试验确定的效应,则发生协同作用。在上述公式中,A 为以施用量 x 单独施用的一种组分以控制度百分比表示的杀真菌活性。B 项为以施用量 y 施用的第二组分以控制度百分比表示的杀真菌活性。所述公式估算 p (以施用量 x 施用的 A 与以施用量 y 施用的 B 的混合物的预期杀真菌活性),如果它们的功效严格上看是加合,则不存在交互作用。

[0756] 测试 K (即测试 K1、K2、K3、K4、K5)

[0757] 在小麦秧苗上喷洒测试悬浮液至流失点。第二天,用小麦白粉病菌(还已知为小麦白粉病菌小麦白粉病的致病原)的孢子粉剂感染所述秧苗,并且在 20℃的生长室中培养 7 天,其后进行目视病害评定。

[0758] 测试 L (即测试 L1、L2、L3、L4、L5)

[0759] 在小麦秧苗上喷洒测试悬浮液至流失点。第二天,用隐匿柄锈菌(Puccinia recondita f.sp.tritici)(小麦叶锈病的致病原)的孢子悬浮液感染所述秧苗,并且在

20℃的饱和氛中培养 24h，然后转移到 20℃的生长室中培养 6 天，其后进行目视病害评定。

[0760] 测试 M（即测试 M1、M2、M3、M4、M5）

[0761] 在小麦秧苗上喷洒测试悬浮液至流失点。第二天，用叶枯病菌（Septoria tritici）（小麦叶斑枯病致病原）的孢子悬浮液感染所述秧苗，并且在 24℃的饱和氛中培养 48h，然后所述秧苗被转移到 20℃的生长室中再培养 19 天，其后进行目视病害评定。

[0762] 测试 K-M 的结果存在于下表 B 至 K 中。100 的等级表明 100% 病害控制，并且 0 的等级表明无病害控制（相对于对照物）。破折号（-）表示无测试结果。标注“Obsd”的栏表示由三次重复试验观测的平均结果。标注“Exp”的栏表示对于每个使用 Colby 公式计算的处理混合物的预期效果。

[0763] 表 B

[0764] 化合物 81 单独和与快诺芬、烯丙异噻唑、代森锰锌、异菌脲、啶酰菌胺、氢氧化铜、霜脲氰或丙氧喹啉的混合物对于控制小麦白粉病或叶锈蜱的观测的和预期的效果

[0765]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 K1		测试 L1	
			观测的	预期的	观测的	预期的
0	无	0	0		0	
1	无	0	0		88	
2	无	0	87		68	
5	无	0	99		91	
10	无	0	100		98	
0	快诺芬	10			0	
0	快诺芬	40			0	
0	快诺芬	200			0	
2	快诺芬	10			18	68
2	快诺芬	40			23	68
2	快诺芬	200			38	68
5	快诺芬	10			60	91
5	快诺芬	40			41	91
5	快诺芬	200			47	91
0	烯丙异噻唑	10	68		9	
0	烯丙异噻唑	40	21		18	
0	烯丙异噻唑	200	71		18	
2	烯丙异噻唑	10	97	96	54	71
2	烯丙异噻唑	40	99	90	85	74
2	烯丙异噻唑	200	98	96	74	74
5	烯丙异噻唑	10	100	100	92	92
5	烯丙异噻唑	40	100	99	96	93
5	烯丙异噻唑	200	100	100	94	93
0	代森锰锌	10	0		54	
0	代森锰锌	40	0		88	
0	代森锰锌	200	0		98	
2	代森锰锌	10	79	87	80	85
2	代森锰锌	40	87	87	91	96
2	代森锰锌	200	84	87	99	99
5	代森锰锌	10	96	99	85	96
5	代森锰锌	40	99	99	98	99
5	代森锰锌	200	99	99	99	100
0	异菌脲	10	0		0	

[0766]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 K1		测试 L1	
			观测的	预期的	观测的	预期的
0	异菌脲	40	0		0	
0	异菌脲	200	21		0	
2	异菌脲	10	96	87	27	68
2	异菌脲	40	92	87	27	68
2	异菌脲	200	94	90	41	68
5	异菌脲	10	99	99	68	91
5	异菌脲	40	99	99	80	91
5	异菌脲	200	99	99	85	91
0	啶酰菌胺	10	0		0	
0	啶酰菌胺	40	0		54	
0	啶酰菌胺	200	0		92	
2	啶酰菌胺	10	0	87	76	68
2	啶酰菌胺	40	0	87	86	85
2	啶酰菌胺	200	64	87	99	97
5	啶酰菌胺	10	86	99	89	91
5	啶酰菌胺	40	94	99	98	96
5	啶酰菌胺	200	97	99	98	99
0	氢氧化铜	10	0		0	
0	氢氧化铜	40	0		0	
0	氢氧化铜	200	0		0	
2	氢氧化铜	10	71	87	9	68
2	氢氧化铜	40	0	87	0	68
2	氢氧化铜	200	0	87	0	68
5	氢氧化铜	10	97	99	41	91
5	氢氧化铜	40	94	99	18	91
5	氢氧化铜	200	93	99	41	91
0	霜脲氰	10	0		0	
0	霜脲氰	40	0		0	
0	霜脲氰	200	50		18	
2	霜脲氰	10	73	87	9	68
2	霜脲氰	40	89	87	9	68
2	霜脲氰	200	91	93	54	74
5	霜脲氰	10	96	99	18	91
5	霜脲氰	40	98	99	54	91
5	霜脲氰	200	97	100	74	93
0	丙氧喹啉	10			0	
0	丙氧喹啉	40			0	
0	丙氧喹啉	200			0	
2	丙氧喹啉	10			0	68

[0767]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 K1		测试 L1	
			观测的	预期的	观测的	预期的
2	丙氧喹啉	40			18	68
2	丙氧喹啉	200			27	68
5	丙氧喹啉	10			18	91
5	丙氧喹啉	40			27	91
5	丙氧喹啉	200			68	91

[0768] 表 C

[0769] 化合物 81 单独和与百菌清、三环唑、氟啶胺、烯酰吗啉、咯菌腈、丙森锌、甲霜灵 -M 或灭菌丹的混合物对于控制小麦白粉病或叶锈蜱的观测的和预期的效果

[0770]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 K2		测试 L2	
			观测的	预期的	观测的	预期的
0	无	0	63		0	
1	无	0	91		9	
2	无	0	91		27	
5	无	0	91		74	
10	无	0	100		91	
0	百菌清	10	58		0	
0	百菌清	40	68		41	
0	百菌清	200	79		91	
2	百菌清	10	92	96	18	27
2	百菌清	40	100	97	85	57
2	百菌清	200	97	98	96	93
5	百菌清	10	100	96	66	74
5	百菌清	40	100	97	88	85
5	百菌清	200	100	98	96	98
0	三环唑	10	0		0	
0	三环唑	40	29		0	
0	三环唑	200	79		0	
2	三环唑	10	99	91	27	27
2	三环唑	40	99	94	27	27
2	三环唑	200	98	98	27	27
5	三环唑	10	100	91	55	74
5	三环唑	40	100	94	68	74
5	三环唑	200	100	98	80	74
0	氟啶胺	10	85		18	
0	氟啶胺	40	96		41	
0	氟啶胺	200	100		74	
2	氟啶胺	10	84	99	41	41
2	氟啶胺	40	99	100	68	57
2	氟啶胺	200	99	100	91	81
5	氟啶胺	10	100	99	80	79
5	氟啶胺	40	100	100	80	85
5	氟啶胺	200	100	100	91	93
0	烯酰吗啉	10	82		9	
0	烯酰吗啉	40	71		9	
0	烯酰吗啉	200	82		0	
2	烯酰吗啉	10	99	98	18	34
2	烯酰吗啉	40	100	98	18	34
2	烯酰吗啉	200	99	98	27	27

[0771]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 K2		测试 L2	
			观测的	预期的	观测的	预期的
5	烯酰吗啉	10	100	98	60	76
5	烯酰吗啉	40	100	98	68	76
5	烯酰吗啉	200	100	98	68	74
0	咯菌腈	10	82		0	
0	咯菌腈	40	92		0	
0	咯菌腈	200	96		9	
2	咯菌腈	10	100	98	27	27
2	咯菌腈	40	99	99	27	27
2	咯菌腈	200	100	100	27	34
5	咯菌腈	10	100	98	41	74
5	咯菌腈	40	100	99	55	74
5	咯菌腈	200	100	100	74	76
0	丙森锌	10	71		0	
0	丙森锌	40	74		0	
0	丙森锌	200	56		9	
2	丙森锌	10	100	98	27	27
2	丙森锌	40	100	98	27	27
2	丙森锌	200	99	96	27	34
5	丙森锌	10	100	98	74	74
5	丙森锌	40	100	98	74	74
5	丙森锌	200	100	96	85	76
0	甲霜灵-M	10	56		0	
0	甲霜灵-M	40	64		0	
0	甲霜灵-M	200	21		0	
2	甲霜灵-M	10	96	96	27	27
2	甲霜灵-M	40	99	97	27	27
2	甲霜灵-M	200	99	93	27	27
5	甲霜灵-M	10	100	96	55	74
5	甲霜灵-M	40	100	97	55	74
5	甲霜灵-M	200	100	93	68	74
0	灭菌丹	10	0		0	
0	灭菌丹	40	0		27	
0	灭菌丹	200	21		55	
2	灭菌丹	10	93	91	0	27
2	灭菌丹	40	96	91	27	47
2	灭菌丹	200	66	93	80	67
5	灭菌丹	10	100	91	74	74
5	灭菌丹	40	100	91	88	81
5	灭菌丹	200	100	93	93	88

[0772] 表 D

[0773] 化合物 81 单独和与萘吡菌胺（isopyrazam）、BAS600、广谱杀菌剂、吡噻菌胺、螺环

菌胺、腈菌唑或丁苯吗啉的混合物对于控制小麦白粉病或叶锈蜱的观测的和预期的效果

[0774]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 K3		测试 L3	
			观测的	预期的	观测的	预期的
0	无	0	0		0	
1	无	0	0		9	
2	无	0	0		9	
5	无	0	90		41	
10	无	0	99		88	
0	萘吡菌胺（isopyrazam）	0.08	0			
0	萘吡菌胺（isopyrazam）	0.4	50			
0	萘吡菌胺（isopyrazam）	2	99			
0	萘吡菌胺（isopyrazam）	10	99			
2	萘吡菌胺（isopyrazam）	0.08	0	0		
2	萘吡菌胺（isopyrazam）	0.4	64	50		
2	萘吡菌胺（isopyrazam）	2	94	99		
2	萘吡菌胺（isopyrazam）	10	100	99		
5	萘吡菌胺（isopyrazam）	0.08	99	90		
5	萘吡菌胺（isopyrazam）	0.4	100	95		
5	萘吡菌胺（isopyrazam）	2	100	100		
5	萘吡菌胺（isopyrazam）	10	100	100		
0	BAS600	0.08	0		74	
0	BAS600	0.4	0		88	

[0775]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 K3		测试 L3	
			观测的	预期的	观测的	预期的
0	BAS600	2	96		99	
0	BAS600	10	100		100	
2	BAS600	0.08	0	0	74	76
2	BAS600	0.4	0	0	94	89
2	BAS600	2	93	96	100	99
2	BAS600	10	99	100	100	100
5	BAS600	0.08	100	90	92	84
5	BAS600	0.4	99	90	99	93
5	BAS600	2	100	100	100	99
5	BAS600	10	100	100	100	100
0	广谱杀菌剂	0.08	0		9	
0	广谱杀菌剂	0.4	0		88	
0	广谱杀菌剂	2	64		99	
0	广谱杀菌剂	10	99		100	
2	广谱杀菌剂	0.08	0	0	18	17
2	广谱杀菌剂	0.4	0	0	80	89
2	广谱杀菌剂	2	90	64	99	99
2	广谱杀菌剂	10	99	99	100	100
5	广谱杀菌剂	0.08	99	90	68	46
5	广谱杀菌剂	0.4	100	90	94	93
5	广谱杀菌剂	2	100	96	100	99
5	广谱杀菌剂	10	100	100	100	100
0	吡噻菌胺	0.08	0			
0	吡噻菌胺	0.4	0			
0	吡噻菌胺	2	99			
0	吡噻菌胺	10	100			
2	吡噻菌胺	0.08	0	0		
2	吡噻菌胺	0.4	42	0		
2	吡噻菌胺	2	99	99		
2	吡噻菌胺	10	100	100		
5	吡噻菌胺	0.08	99	90		
5	吡噻菌胺	0.4	100	90		
5	吡噻菌胺	2	100	100		
5	吡噻菌胺	10	100	100		
0	螺环菌胺	0.4	0		0	
0	螺环菌胺	2	0		0	
0	螺环菌胺	10	0		0	
0	螺环菌胺	40	99		91	
2	螺环菌胺	0.4	0	0	18	9
2	螺环菌胺	2	0	0	9	9

[0776]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 K3		测试 L3	
			观测的	预期的	观测的	预期的
2	螺环菌胺	10	0	0	9	9
2	螺环菌胺	40	100	99	60	92
5	螺环菌胺	0.4	97	90	45	41
5	螺环菌胺	2	96	90	41	41
5	螺环菌胺	10	98	90	80	41
5	螺环菌胺	40	100	100	95	95
0	腈菌唑	0.4	0		0	
0	腈菌唑	2	86		0	
0	腈菌唑	10	99		41	
0	腈菌唑	40	100		99	
2	腈菌唑	0.4	42	0	0	9
2	腈菌唑	2	93	86	0	9
2	腈菌唑	10	100	99	41	46
2	腈菌唑	40	100	100	100	99
5	腈菌唑	0.4	98	90	27	41
5	腈菌唑	2	99	99	68	41
5	腈菌唑	10	100	100	93	65
5	腈菌唑	40	100	100	100	99
0	丁苯吗啉	0.4	50		0	
0	丁苯吗啉	2	96		0	
0	丁苯吗啉	10	100		88	
0	丁苯吗啉	40	100		100	
2	丁苯吗啉	0.4	85	50	0	9
2	丁苯吗啉	2	97	96	41	9
2	丁苯吗啉	10	100	100	97	89
2	丁苯吗啉	40	100	100	100	100
5	丁苯吗啉	0.4	96	95	54	41
5	丁苯吗啉	2	100	100	83	41
5	丁苯吗啉	10	100	100	99	93
5	丁苯吗啉	40	100	100	100	100

[0777] 表 E

[0778] 化合物 81 单独和与恶醚唑、嘧菌酯、氟醚唑、唑菌胺酯、丙硫菌唑、啶氧菌酯或氟环唑的混合物对于控制小麦白粉病或叶锈蜱的观测的和预期的效果

[0779]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 K4		测试 L4	
			观测的	预期的	观测的	预期的
0	无	0	0		0	
1	无	0	0		0	
2	无	0	0		27	
5	无	0	0		68	
10	无	0	–		88	
0	恶醚唑	0.08	0			
0	恶醚唑	0.4	0			
0	恶醚唑	2	81			
0	恶醚唑	10	99			
2	恶醚唑	0.08	0	0		
2	恶醚唑	0.4	21	0		
2	恶醚唑	2	90	81		
2	恶醚唑	10	100	99		
5	恶醚唑	0.08	98	0		
5	恶醚唑	0.4	97	0		
5	恶醚唑	2	98	81		
5	恶醚唑	10	100	99		
0	嘧菌酯	0.08	0			
0	嘧菌酯	0.4	0			
0	嘧菌酯	2	0			
0	嘧菌酯	10	96			
2	嘧菌酯	0.08	0	0		
2	嘧菌酯	0.4	0	0		
2	嘧菌酯	2	0	0		
2	嘧菌酯	10	97	96		
5	嘧菌酯	0.08	97	0		
5	嘧菌酯	0.4	96	0		
5	嘧菌酯	2	98	0		
5	嘧菌酯	10	100	96		
0	氟醚唑	0.08	0		0	
0	氟醚唑	0.4	21		0	
0	氟醚唑	2	93		27	
0	氟醚唑	10	97		99	
2	氟醚唑	0.08	0	0	0	27
2	氟醚唑	0.4	0	21	9	27
2	氟醚唑	2	55	93	60	47
2	氟醚唑	10	99	97	100	99
5	氟醚唑	0.08	94	0	74	68

[0780]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 K4		测试 L4	
			观测的	预期的	观测的	预期的
5	氟醚唑	0.4	94	21	74	68
5	氟醚唑	2	97	93	98	77
5	氟醚唑	10	100	97	100	100
0	唑菌胺酯	0.08	0		9	
0	唑菌胺酯	0.4	0		80	
0	唑菌胺酯	2	0		98	
0	唑菌胺酯	10	93		100	
2	唑菌胺酯	0.08	0	0	27	34
2	唑菌胺酯	0.4	0	0	85	85
2	唑菌胺酯	2	58	0	97	99
2	唑菌胺酯	10	94	93	100	100
5	唑菌胺酯	0.08	97	0	74	71
5	唑菌胺酯	0.4	96	0	94	94
5	唑菌胺酯	2	98	0	100	99
5	唑菌胺酯	10	99	93	100	100
0	丙硫菌唑	0.08	0		0	
0	丙硫菌唑	0.4	0		0	
0	丙硫菌唑	2	0		9	
0	丙硫菌唑	10	93		9	
2	丙硫菌唑	0.08	0	0	0	27
2	丙硫菌唑	0.4	0	0	0	27
2	丙硫菌唑	2	47	0	0	34
2	丙硫菌唑	10	98	93	27	34
5	丙硫菌唑	0.08	96	0	80	68
5	丙硫菌唑	0.4	96	0	74	68
5	丙硫菌唑	2	97	0	55	71
5	丙硫菌唑	10	98	93	74	71
0	啶氧菌酯	0.08	0		0	
0	啶氧菌酯	0.4	0		9	
0	啶氧菌酯	2	0		82	
0	啶氧菌酯	10	99		100	
2	啶氧菌酯	0.08	0	0	0	27
2	啶氧菌酯	0.4	0	0	27	34
2	啶氧菌酯	2	42	0	85	87
2	啶氧菌酯	10	100	99	100	100
5	啶氧菌酯	0.08	93	0	60	68
5	啶氧菌酯	0.4	95	0	80	71
5	啶氧菌酯	2	96	0	90	94
5	啶氧菌酯	10	100	99	100	100

[0781]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 K4		测试 L4	
			观测的	预期的	观测的	预期的
0	氟环唑	0.08	0		0	
0	氟环唑	0.4	90		93	
0	氟环唑	2	98		99	
0	氟环唑	10	100		100	
2	氟环唑	0.08	0	0	55	27
2	氟环唑	0.4	29	90	97	95
2	氟环唑	2	99	98	99	99
2	氟环唑	10	100	100	100	100
5	氟环唑	0.08	93	0	91	68
5	氟环唑	0.4	98	90	100	98
5	氟环唑	2	100	98	100	100
5	氟环唑	10	100	100	100	100

[0782] 表 F

[0783] 化合物 81 单独和与快诺芬、环丙唑醇、吡噻菌胺、萘吡菌胺（isopyrazam）、恶醚唑、嘧菌酯或丙氧喹啉的混合物对于控制小麦白粉病或叶锈蜱的观测的和预期的效果

[0784]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 K5		测试 L5	
			观测的	预期的	观测的	预期的
0	无	0	0		0	
1	无	0	0		18	
2	无	0	0		27	
5	无	0	0		55	
10	无	0	100		82	
0	快诺芬	0.016	21		--	
0	快诺芬	0.08	29		--	
0	快诺芬	0.4	64		--	
0	快诺芬	2	93		--	
2	快诺芬	0.016	90	21	--	
2	快诺芬	0.08	87	29	--	
2	快诺芬	0.4	90	64	--	
2	快诺芬	2	99	93	--	
5	快诺芬	0.016	99	21	--	
5	快诺芬	0.08	100	29	--	
5	快诺芬	0.4	100	64	--	
5	快诺芬	2	100	93	--	

[0785]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 K5		测试 L5	
			观测的	预期的	观测的	预期的
0	环丙唑醇	0.016	64		27	
0	环丙唑醇	0.08	64		80	
0	环丙唑醇	0.4	79		92	
0	环丙唑醇	2	96		100	
2	环丙唑醇	0.016	42	64	55	47
2	环丙唑醇	0.08	64	64	74	85
2	环丙唑醇	0.4	96	79	93	94
2	环丙唑醇	2	100	96	100	100
5	环丙唑醇	0.016	100	64	68	67
5	环丙唑醇	0.08	99	64	97	91
5	环丙唑醇	0.4	100	79	98	96
5	环丙唑醇	2	100	96	100	100
0	吡噻菌胺	0.016	--		9	
0	吡噻菌胺	0.08	--		55	
0	吡噻菌胺	0.4	--		68	
0	吡噻菌胺	2	--		99	
2	吡噻菌胺	0.016	--		55	34
2	吡噻菌胺	0.08	--		68	67
2	吡噻菌胺	0.4	--		68	77
2	吡噻菌胺	2	--		99	99
5	吡噻菌胺	0.016	--		74	59
5	吡噻菌胺	0.08	--		80	79
5	吡噻菌胺	0.4	--		88	85
5	吡噻菌胺	2	--		100	100
0	萘吡菌胺（isopyrazam）	0.016	--		68	
0	萘吡菌胺（isopyrazam）	0.08	--		89	
0	萘吡菌胺（isopyrazam）	0.4	--		100	
0	萘吡菌胺（isopyrazam）	2	--		100	
2	萘吡菌胺（isopyrazam）	0.016	--		74	77
2	萘吡菌胺（isopyrazam）	0.08	--		88	92
2	萘吡菌胺（isopyrazam）	0.4	--		100	100

[0786]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 K5		测试 L5	
			观测的	预期的	观测的	预期的
2	苯吡菌胺（isopyrazam）	2	–		100	100
5	苯吡菌胺（isopyrazam）	0.016	–		88	85
5	苯吡菌胺（isopyrazam）	0.08	–		99	95
5	苯吡菌胺（isopyrazam）	0.4	–		100	100
5	苯吡菌胺（isopyrazam）	2	–		100	100
0	恶醚唑	0.016	–		68	
0	恶醚唑	0.08	–		68	
0	恶醚唑	0.4	–		92	
0	恶醚唑	2	–		100	
2	恶醚唑	0.016	–		27	77
2	恶醚唑	0.08	–		41	77
2	恶醚唑	0.4	–		99	94
2	恶醚唑	2	–		100	100
5	恶醚唑	0.016	–		74	85
5	恶醚唑	0.08	–		80	85
5	恶醚唑	0.4	–		100	96
5	恶醚唑	2	–		100	100
0	嘧菌酯	0.016	–		0	
0	嘧菌酯	0.08	–		68	
0	嘧菌酯	0.4	–		100	
0	嘧菌酯	2	–		100	
2	嘧菌酯	0.016	–		27	27
2	嘧菌酯	0.08	–		74	77
2	嘧菌酯	0.4	–		100	100
2	嘧菌酯	2	–		100	100
5	嘧菌酯	0.016	–		74	55
5	嘧菌酯	0.08	–		97	85
5	嘧菌酯	0.4	–		100	100
5	嘧菌酯	2	–		100	100
0	丙氧喹啉	0.016	0		–	
0	丙氧喹啉	0.08	0		–	
0	丙氧喹啉	0.4	0		–	
0	丙氧喹啉	2	71		–	
2	丙氧喹啉	0.016	0	0	–	

[0787]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 K5		测试 L5	
			观测的	预期的	观测的	预期的
2	丙氧喹啉	0.08	0	0	--	
2	丙氧喹啉	0.4	0	0	--	
2	丙氧喹啉	2	87	71	--	
5	丙氧喹啉	0.016	87	0	--	
5	丙氧喹啉	0.08	89	0	--	
5	丙氧喹啉	0.4	93	0	--	
5	丙氧喹啉	2	98	71	--	

[0788] 表 G

[0789] 化合物 81 单独和与烯丙异噻唑、代森锰锌、异菌脲、啶酰菌胺、氢氧化铜、霜脲氰或百菌清的混合物对于控制小麦白粉病或叶锈蜱的观测的 和预期的效果

[0790]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 M1	
			观测的	预期的
0	无	0	0	
0.01	无	0	0	
0.1	无	0	0	
1	无	0	86	
10	无	0	100	
0	烯丙异噻唑	10	0	
0	烯丙异噻唑	40	0	
0	烯丙异噻唑	200	0	
0.1	烯丙异噻唑	10	0	0
0.1	烯丙异噻唑	40	0	0
0.1	烯丙异噻唑	200	25	0
1	烯丙异噻唑	10	87	86
1	烯丙异噻唑	40	94	86
1	烯丙异噻唑	200	87	86
0	代森锰锌	10	0	
0	代森锰锌	40	55	
0	代森锰锌	200	91	
0.1	代森锰锌	10	0	0
0.1	代森锰锌	40	63	55
0.1	代森锰锌	200	96	91
1	代森锰锌	10	81	86
1	代森锰锌	40	98	94

[0791]

化合物81的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试M1	
			观测的	预期的
1	代森锰锌	200	100	99
0	异菌脲	10	0	
0	异菌脲	40	0	
0	异菌脲	200	0	
0.1	异菌脲	10	0	0
0.1	异菌脲	40	0	0
0.1	异菌脲	200	22	0
1	异菌脲	10	88	86
1	异菌脲	40	91	86
1	异菌脲	200	98	86
0	啶酰菌胺	10	77	
0	啶酰菌胺	40	90	
0	啶酰菌胺	200	99	
0.1	啶酰菌胺	10	72	77
0.1	啶酰菌胺	40	98	90
0.1	啶酰菌胺	200	98	99
1	啶酰菌胺	10	99	97
1	啶酰菌胺	40	100	99
1	啶酰菌胺	200	100	100
0	氢氧化铜	10	0	
0	氢氧化铜	40	45	
0	氢氧化铜	200	77	
0.1	氢氧化铜	10	0	0
0.1	氢氧化铜	40	25	45
0.1	氢氧化铜	200	87	77
1	氢氧化铜	10	72	86
1	氢氧化铜	40	93	92
1	氢氧化铜	200	99	97
0	霜脲氰	10	0	
0	霜脲氰	40	0	
0	霜脲氰	200	0	
0.1	霜脲氰	10	0	0
0.1	霜脲氰	40	0	0
0.1	霜脲氰	200	0	0
1	霜脲氰	10	96	86
1	霜脲氰	40	85	86
1	霜脲氰	200	96	86
0	百菌清	10	0	
0	百菌清	40	42	

[0792]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 M1	
			观测的	预期的
0	百菌清	200	99	
0.1	百菌清	10	0	0
0.1	百菌清	40	75	42
0.1	百菌清	200	98	99
1	百菌清	10	72	86
1	百菌清	40	80	92
1	百菌清	200	99	100

[0793] 表 H

[0794] 化合物 81 单独和与 BAS600、萘吡菌胺（isopyrazam）、吡噻菌胺、广谱杀菌剂或环丙唑醇的混合物对于控制小麦叶疹斑的观测的和预期的效果

[0795]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 M2	
			观测的	预期的
0	无	0	0	
0.01	无	0	0	
0.1	无	0	0	
1	无	0	95	
10	无	0	100	
0	BAS600	0.016	0	
0	BAS600	0.08	0	
0	BAS600	0.4	93	
0	BAS600	2	100	
0.1	BAS600	0.02	0	0
0.1	BAS600	0.08	38	0
0.1	BAS600	0.40	96	93
0.1	BAS600	2	100	100
1	BAS600	0.02	65	95
1	BAS600	0.08	85	95
1	BAS600	0.40	97	100
1	BAS600	2	99	100
0	萘吡菌胺（isopyrazam）	0.08	0	
0	萘吡菌胺（isopyrazam）	0.40	77	
0	萘吡菌胺（isopyrazam）	2	93	
0	萘吡菌胺（isopyrazam）	10	100	
0.1	萘吡菌胺（isopyrazam）	0.08	0	0
0.1	萘吡菌胺（isopyrazam）	0.40	72	77

[0796]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 M2	
			观测的	预期的
0.1	萘吡菌胺（isopyrazam）	2	--	
0.1	萘吡菌胺（isopyrazam）	10	--	
1	萘吡菌胺（isopyrazam）	0.08	--	
1	萘吡菌胺（isopyrazam）	0.40	80	99
1	萘吡菌胺（isopyrazam）	2	--	
1	萘吡菌胺（isopyrazam）	10	100	100
0	吡噻菌胺	0.08	0	
0	吡噻菌胺	0.40	0	
0	吡噻菌胺	2	--	
0	吡噻菌胺	10	--	
0.1	吡噻菌胺	0.08	0	0
0.1	吡噻菌胺	0.40	17	0
0.1	吡噻菌胺	2	--	
0.1	吡噻菌胺	10	99	
1	吡噻菌胺	0.08	83	95
1	吡噻菌胺	0.40	73	95
1	吡噻菌胺	2	--	
1	吡噻菌胺	10	99	
0	广谱杀菌剂	0.08	0	
0	广谱杀菌剂	0.40	33	
0	广谱杀菌剂	2	89	
0	广谱杀菌剂	10	--	
0.1	广谱杀菌剂	0.08	0	0
0.1	广谱杀菌剂	0.40	33	33
0.1	广谱杀菌剂	2	83	89
0.1	广谱杀菌剂	10	100	
1	广谱杀菌剂	0.08	--	
1	广谱杀菌剂	0.4	85	97
1	广谱杀菌剂	2	--	
1	广谱杀菌剂	10	--	
0	环丙唑醇	0.4	0	
0	环丙唑醇	2	0	
0	环丙唑醇	10	0	
0	环丙唑醇	40	98	
0.1	环丙唑醇	0.4	0	0
0.1	环丙唑醇	2	0	0
0.1	环丙唑醇	10	0	0
0.1	环丙唑醇	40	98	98
1	环丙唑醇	0.4	73	95

[0797]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 M2	
			观测的	预期的
1	环丙唑醇	2	63	95
1	环丙唑醇	10	97	95
1	环丙唑醇	40	100	100

[0798] 表 I

[0799] 化合物 81 单独和与咯菌腈、氟环唑、丙硫菌唑、恶醚唑或丁苯吗啉的混合物对于控制小麦叶疹斑的观测的和预期的效果

[0800]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 M3	
			观测的	预期的
0	无	0	0	
0.01	无	0	0	
0.1	无	0	0	
1	无	0	52	
10	无	0	100	
0	咯菌腈	0.08	0	
0	咯菌腈	0.4	0	
0	咯菌腈	2	37	
0	咯菌腈	10	67	
0.1	咯菌腈	0.08	0	0
0.1	咯菌腈	0.4	0	0
0.1	咯菌腈	2	30	37
0.1	咯菌腈	10	57	67
1	咯菌腈	0.08	83	52
1	咯菌腈	0.4	45	52
1	咯菌腈	2	68	69
1	咯菌腈	10	78	84
0	氟环唑	0.4	0	
0	氟环唑	2	0	
0	氟环唑	10	76	
0	氟环唑	40	100	
0.1	氟环唑	0.4	0	0
0.1	氟环唑	2	0	0
0.1	氟环唑	10	75	76
0.1	氟环唑	40	98	100
1	氟环唑	0.4	78	52
1	氟环唑	2	78	52

[0801]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 M3	
			观测的	预期的
1	氟环唑	10	97	89
1	氟环唑	40	100	100
0	丙硫菌唑	0.4	0	
0	丙硫菌唑	2	0	
0	丙硫菌唑	10	18	
0	丙硫菌唑	40	85	
0.1	丙硫菌唑	0.4	0	0
0.1	丙硫菌唑	2	0	0
0.1	丙硫菌唑	10	25	18
0.1	丙硫菌唑	40	–	
1	丙硫菌唑	0.4	48	52
1	丙硫菌唑	2	25	52
1	丙硫菌唑	10	73	61
1	丙硫菌唑	40	88	93
0	恶醚唑	0.4	0	
0	恶醚唑	2	0	
0	恶醚唑	10	52	
0	恶醚唑	40	95	
0.1	恶醚唑	0.4	0	0
0.1	恶醚唑	2	0	0
0.1	恶醚唑	10	57	52
0.1	恶醚唑	40	98	95
1	恶醚唑	0.4	78	52
1	恶醚唑	2	50	52
1	恶醚唑	10	88	77
1	恶醚唑	40	100	97
0	丁苯吗啉	2	0	
0	丁苯吗啉	10	0	
0	丁苯吗啉	40	0	
0	丁苯吗啉	200	0	
0.1	丁苯吗啉	2	0	0
0.1	丁苯吗啉	10	0	0
0.1	丁苯吗啉	40	0	0
0.1	丁苯吗啉	200	0	0
1	丁苯吗啉	2	85	52
1	丁苯吗啉	10	75	52
1	丁苯吗啉	40	86	52
1	丁苯吗啉	200	98	52

[0802] 表 J

[0803] 化合物 81 单独和与唑菌胺酯、三环唑、氟啶胺、烯酰吗啉、丙森锌、甲霜灵 -M、灭菌丹或腈菌唑的混合物对于控制小麦叶疹斑的观测的和预期的效果

[0804]

化合物81的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试M4	
			观测的	预期的
0	无	0	0	
0.01	无	0	0	
0.1	无	0	23	
1	无	0	66	
10	无	0	100	
0	唑菌胺酯	10	0	
0	唑菌胺酯	40	26	
0	唑菌胺酯	200	93	
0.1	唑菌胺酯	10	0	23
0.1	唑菌胺酯	40	32	43
0.1	唑菌胺酯	200	91	94
1	唑菌胺酯	10	79	66
1	唑菌胺酯	40	90	75
1	唑菌胺酯	200	97	98
0	三环唑	10	0	
0	三环唑	40	0	
0	三环唑	200	0	
0.1	三环唑	10	0	23
0.1	三环唑	40	0	23
0.1	三环唑	200	0	23
1	三环唑	10	74	66
1	三环唑	40	93	66
1	三环唑	200	74	66
0	氟啶胺	10	0	
0	氟啶胺	40	0	
0	氟啶胺	200	93	
0.1	氟啶胺	10	13	23
0.1	氟啶胺	40	60	23
0.1	氟啶胺	200	85	95
1	氟啶胺	10	76	66
1	氟啶胺	40	97	66
1	氟啶胺	200	100	98

[0805]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 M4	
			观测的	预期的
0	烯酰吗啉	10	0	
0	烯酰吗啉	40	0	
0	烯酰吗啉	200	0	
0.1	烯酰吗啉	10	0	23
0.1	烯酰吗啉	40	0	23
0.1	烯酰吗啉	200	16	23
1	烯酰吗啉	10	93	66
1	烯酰吗啉	40	91	66
1	烯酰吗啉	200	0	66
0	丙森锌	10	0	
0	丙森锌	40	0	
0	丙森锌	200	0	
0.1	丙森锌	10	0	23
0.1	丙森锌	40	23	23
0.1	丙森锌	200	53	23
1	丙森锌	10	81	66
1	丙森锌	40	96	66
1	丙森锌	200	96	66
0	甲霜灵-M	10	0	
0	甲霜灵-M	40	0	
0	甲霜灵-M	200	0	
0.1	甲霜灵-M	10	0	23
0.1	甲霜灵-M	40	0	23
0.1	甲霜灵-M	200	32	23
1	甲霜灵-M	10	86	66
1	甲霜灵-M	40	96	66
1	甲霜灵-M	200	96	66
0	灭菌丹	10	0	
0	灭菌丹	40	73	
0	灭菌丹	200	91	
0.1	灭菌丹	10	32	23
0.1	灭菌丹	40	86	79
0.1	灭菌丹	200	93	93
1	灭菌丹	10	91	66
1	灭菌丹	40	91	91
1	灭菌丹	200	98	97
0	腈菌唑	10	0	
0	腈菌唑	40	44	
0	腈菌唑	200	74	

[0806]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 M4	
			观测的	预期的
0.1	腈菌唑	10	13	23
0.1	腈菌唑	40	0	57
0.1	腈菌唑	200	61	80
1	腈菌唑	10	16	66
1	腈菌唑	40	91	81
1	腈菌唑	200	74	91

[0807] 表 K

[0808] 化合物 81 单独和与快诺芬、嘧菌酯、啶氧菌酯、氟酰唑、螺环菌胺或丙氧喹啉的混合物对于控制小麦叶疹斑的观测的和预期的效果

[0809]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 M5	
			观测的	预期的
0	无	0	0	
0.01	无	0	0	
0.1	无	0	3	
1	无	0	90	
10	无	0	100	
0	快诺芬	10	0	
0	快诺芬	40	0	
0	快诺芬	200	8	
0.1	快诺芬	10	0	3
0.1	快诺芬	40	0	3
0.1	快诺芬	200	0	11
1	快诺芬	10	95	90
1	快诺芬	40	99	90
1	快诺芬	200	99	91
0	嘧菌酯	10	0	
0	嘧菌酯	40	20	
0	嘧菌酯	200	50	
0.1	嘧菌酯	10	0	3
0.1	嘧菌酯	40	3	23
0.1	嘧菌酯	200	61	52
1	嘧菌酯	10	90	90
1	嘧菌酯	40	94	92
1	嘧菌酯	200	93	95
0	啶氧菌酯	10	0	

[0810]

化合物 81 的施用量（ppm）	组分（b）	组分（b）的施用量（ppm）	测试 M5	
			观测的	预期的
0	啶氧菌酯	40	0	
0	啶氧菌酯	200	0	
0.1	啶氧菌酯	10	0	3
0.1	啶氧菌酯	40	0	3
0.1	啶氧菌酯	200	0	3
1	啶氧菌酯	10	79	90
1	啶氧菌酯	40	70	90
1	啶氧菌酯	200	85	90
0	氟醚唑	10	0	
0	氟醚唑	40	7	
0	氟醚唑	200	99	
0.1	氟醚唑	10	13	3
0.1	氟醚唑	40	60	10
0.1	氟醚唑	200	99	99
1	氟醚唑	10	87	90
1	氟醚唑	40	99	91
1	氟醚唑	200	100	100
0	螺环菌胺	10	0	
0	螺环菌胺	40	3	
0	螺环菌胺	200	0	
0.1	螺环菌胺	10	0	3
0.1	螺环菌胺	40	0	7
0.1	螺环菌胺	200	7	3
1	螺环菌胺	10	88	90
1	螺环菌胺	40	85	90
1	螺环菌胺	200	100	90
0	丙氧喹啉	10	0	
0	丙氧喹啉	40	0	
0	丙氧喹啉	200	0	
0.1	丙氧喹啉	10	0	3
0.1	丙氧喹啉	40	0	3
0.1	丙氧喹啉	200	0	3
1	丙氧喹啉	10	22	90
1	丙氧喹啉	40	55	90
1	丙氧喹啉	200	25	90

[0811] 表 B 至 K 显示包含代表性的式 1 化合物与多种组分(b)化合物的混合物的本发明组合物，在某些情况下展示小麦白粉病、叶锈蜱和叶疹斑的 协同控制。由于控制不能超过 100%，在混合物中增加的活性超过预期的杀真菌活性不一定被观测到，但更可能观测到当单独的活性成分组分自身以施用量提供显著小于 100% 控制时。协同作用在低施用量下可能不明显，其中单独的活性成分组分自身具有很小的活性。然而，在某些情况下，对于其中

在相同的施用量下单独的活性成分组分自身几乎没有或无活性的组合，可观测到较大的活性。如上文所示范的，本发明提供用于控制白粉病（小麦白粉病菌）、叶锈蜱（小麦叶锈病菌）和小麦叶疹斑（叶枯病菌）的方法。

[0812] 测试 N1 和 N2

[0813] 测试 N1 和 N2 涉及评估化合物 81 分别与 2-[（3- 溴 -8- 甲基 -6- 喹啉基）氧]-N-（1,1- 二甲基 -2- 丙炔 -1- 基）-2-（甲硫基）乙酰胺（化合物 A1）和 2-[（3- 溴 -6- 喹啉基）氧]-N-（1,1- 二甲基乙基）丁酰胺（化合物 A2）的混合物用于抑制叶枯病菌（小麦叶疹斑的致病原）生长。对于制备测试组合物的一般规程如下所述。化合物 81（测试 N1 和 N2），化合物 A1（测试 N1）和化合物 A2（测试 N2）作为未配制的、工业级材料获得。未配制的测试化合物首先以适当的浓度被溶解于 DMSO 中以在每个孔包含 200μL 的真菌生长培养基的 96- 孔板的孔中与真菌生长培养基混合之后，提供预期的浓度（以 μM 计）。选择化合物浓度范围以跨越从 0 至接近 100% 的抑制活性范围以鉴定当叶枯病菌被用加入组合中的化合物处理时的任何协同作用。测试化合物的 DMSO 溶液在添加真菌生长培养基之前被加入孔中。

[0814] 所述真菌生长固体培养基通过形成包含磷酸氢二（3.0g/L）、磷酸二氢钾（4.0g/L）、氯化钠（0.5g/L）、氯化铵（1.0g/L）、硫酸镁七水合物（0.2g）和氯化钙二水合物（0.01g/L），并且包含 1mL/L 的痕量元素溶液（硫酸锰水合物（0.1mg/mL）、硫酸锌七水合物（0.2mg/mL）、硫酸铜（II）五水合物（0.2mg/mL）、硫酸铁（II）七水合物（0.2mg/mL）、钼酸钠二水合物（0.1mg/mL）、硫酸钴（II）七水合物（0.06mg/mL），硼酸（0.08mg/mL）并用 50μL/L 的生物素原液溶液（0.1mg/mL）补充的含水混合物制备。用 1M 碳酸钠水溶液调节 pH 至 6.8。所述混合物还用 1g/L 的酵母提取物补充，并添加 GELRITE 结冷胶（Kelco）（4g/L）。加入足够的水以促使体积至 90% 的最终体积（如对于制备 1L 的真菌生长培养基的 900mL 体积）。高压蒸汽处理混合物。在冷却至 60℃时，加入 100mL/L 的右旋糖水溶液（10g/L）、500μL/L 的氨苄青霉素水溶液（100mg/mL）和 500μL/L 的利福平溶液（10mg/mL 于 DMSO 中）以提供真菌生长培养基的最终体积，其然后使用微升移液管在仍然温暖的时候被分配至 96- 孔板的孔中。在每个孔中分配的真菌生长培养基使用分配移液管的末端搅拌以将其与包含所述测试化合物的 DMSO 溶液混合。

[0815] 在孔中的真菌生长培养基已经冷却至室温并固化后，在每个孔中生长培养基的顶部表面用 20μL 包含 8×10^4 个细胞的真菌的悬浮液感染。在无菌纱布中干燥 2h 时间之后，在 25℃下将板置于黑暗的培养箱中 5d。

[0816] 在设定测量 600nm 光照吸光度的板阅读器上评估真菌生长。在测试 N1 和 N2 中观测的生长抑制百分比（Obsd.）以及得自使用 Colby 公式计算的预期的生长抑制百分比（Exp.）分别列于表 L 和 M 中。

[0817] 表 L

[0818] 化合物 81 单独和与化合物 A1 的混合物作为组分（b）对于控制叶枯病菌的观测的和预期的效果

[0819]

化合物 81 的施用量（μM）	化合物 A1 的施用量（μM）	%抑制	
		观测的	预期的
0.2	0	98.0	
0.04	0	93.5	
0.008	0	10.0	
0.0016	0	5.0	
0.00032	0	9.0	
0	0	0	
0	0.2	98.0	
0	0.04	97	
0	0.008	14.5	
0	0.0016	5	
0	0.00032	3	
0	0	0	0
0.2	0.2	98	98
0.2	0.04	98	98
0.2	0.008	98	98
0.2	0.0016	98	98
0.2	0.00032	98	98
0.04	0.2	98	99.0
0.04	0.04	98	99.0

[0820]

化合物 81 的施用量（μM）	化合物 A1 的施用量（μM）	%抑制	
		观测的	预期的
0.04	0.008	98	96.0
0.04	0.0016	94.2	94.0
0.04	0.00032	92	96.0
0.008	0.2	98.0	99.0
0.008	0.04	97.0	99.0
0.008	0.008	62.0	22.0
0.008	0.0016	6.0	14.0
0.008	0.00032	5.0	13.0
0.016	0.2	98.0	98.0
0.016	0.04	97.0	96.0
0.016	0.008	32.0	18.0
0.016	0.0016	5.0	10.0
0.016	0.00032	9.0	8.0
0.0032	0.2	98.0	97.0
0.0032	0.04	94.0	96.0
0.0032	0.008	8.0	22.0
0.0032	0.0016	8.0	14.0
0.0032	0.00032	6.0	12.0

[0821] 表 M

[0822] 化合物 81 单独和与化合物 A2 的混合物作为组分(b)对于控制叶枯病菌的观测的和预期的效果

[0823]

化合物 81 的施用量（μM）	化合物 A2 的施用量（μM）	%抑制	
		观测的	预期的
0.2	0	96.0	
0.04	0	93.5	
0.008	0	29.0	
0.0016	0	0.0	
0.00032	0	0.0	
0	0	0	
0	20	96.0	
0	4	95.0	
0	0.8	11.5	
0	0.16	6.5	
0	0.032	0.0	
0	0	0	
0.2	20	96	100
0.2	4	96	100
0.2	0.8	96	96

[0824]

化合物 81 的施用量（μM）	化合物 A2 的施用量（μM）	%抑制	
		观测的	预期的
0.2	0.16	96	96
0.2	0.032	96	96
0.04	20	96.0	100
0.04	4	96.0	100
0.04	0.8	96.0	94.2
0.04	0.16	95.5	93.9
0.04	0.032	95.0	93.5
0.008	20	96.0	97.2
0.008	4	96.0	96.5
0.008	0.8	68.0	37.2
0.008	0.16	0.0	33.6
0.008	0.032	0.0	29.0
0.016	20	96.0	96.0
0.016	4	96.0	95.0
0.016	0.8	46.5	11.5
0.016	0.16	6.5	6.5
0.016	0.032	0.0	0.0
0.0032	20	96.0	96.0
0.0032	4	95.0	95.0
0.0032	0.8	13.0	11.5
0.0032	0.16	24.5	6.5
0.0032	0.032	1.5	0.0

[0825] 在其中化合物 81 和化合物 A1 分别提供远小于 100% 抑制（允许在抑制中协同增加的表达）的施用量下，并且其中施用量没有由化合物 81 和化合物 A1 分别提供的高抑制的施

用量(如化合物 81 的 0.008 或 0.016μM 的施用量以及化合物 A1 的 0.008μM 的施用量)极大地降低下,得自表 L 中所呈现的在测试 N1 中的化合物 81 与化合物 A1 的混合物的观测和预期的结果显示大于预期的活性(即,协同作用)。类似地,在其中化合物 81 和化合物 A2 分别提供远小于 100% 抑制的施用量下,并且其中施用量没有由化合物 81 和化合物 A2 分别提供的高抑制的施用量(如化合物 81 的 0.008 或 0.016μM 的施用量以及化合物 A2 的 0.8μM 的施用量)极大地降低下,得自表 M 中所呈现的在测试 N2 中的化合物 81 与化合物 A2 的混合物的观测和预期的结果显示大于预期的活性。