



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 105101791 A

(43) 申请公布日 2015. 11. 25

(21) 申请号 201480018587. 7

A01N 55/08(2006. 01)

(22) 申请日 2014. 01. 29

A23B 4/20(2006. 01)

(30) 优先权数据

A23B 7/154(2006. 01)

61/758, 313 2013. 01. 30 US

A01N 59/16(2006. 01)

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

A01N 25/18(2006. 01)

2015. 09. 25

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/US2014/013510 2014. 01. 29

(87) PCT国际申请的公布数据

W02014/120715 EN 2014. 08. 07

(71) 申请人 美国陶氏益农公司

地址 美国印第安纳州

(72) 发明人 D·麦克莱恩 D·H·扬

R·M·雅各布森 M·C·H·亚普

R·A·锡丰特斯 D·H·德弗里斯

(74) 专利代理机构 北京坤瑞律师事务所 11494

代理人 吴培善

(51) Int. Cl.

A01N 3/02(2006. 01)

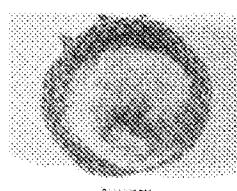
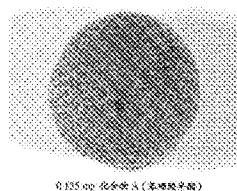
权利要求书11页 说明书60页 附图4页

(54) 发明名称

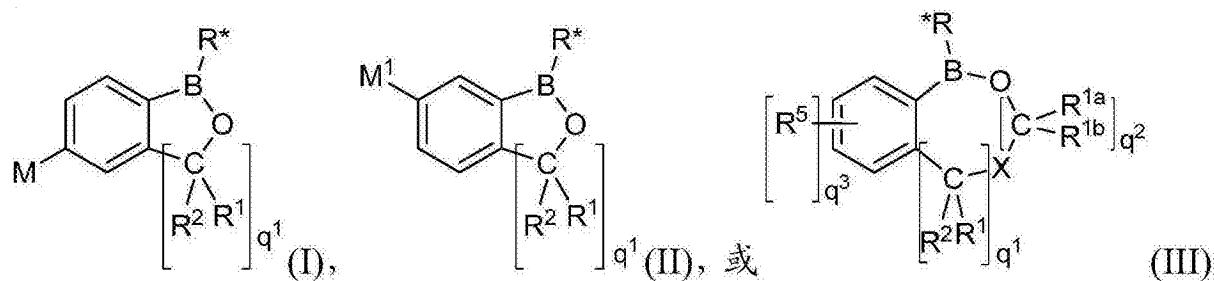
苯硼酸半酯作为挥发性抗微生物剂在肉类、植物或植物部分上的用途

(57) 摘要

本发明涉及挥发性抗微生物化合物抵抗影响肉类、植物或植物部分的病原体的用途。提供的挥发性抗微生物化合物包括某些氧硼戊环化合物，例如苯硼酸半酯。提供利用这些抗微生物化合物的挥发性质的递送系统。还披露了与挥发性植物生长调节剂例如 1- 甲基环丙烯的组合。



1. 使用挥发性抗微生物化合物抵抗影响肉类、植物或植物部分的病原体的方法，其包括将所述肉类、植物或植物部分与有效量的挥发性抗微生物化合物及其农用盐接触，所述挥发性抗微生物化合物具有式 (I), (II) 或 (III) 的结构：



其中 q1 和 q2 独立地为 1, 2, 或 3；

q3 = 0, 1, 2, 3, 或 4；

M 为氢, 卤素,  $-OCH_3$ , 或  $-CH_2-O-CH_2-O-CH_3$ ；

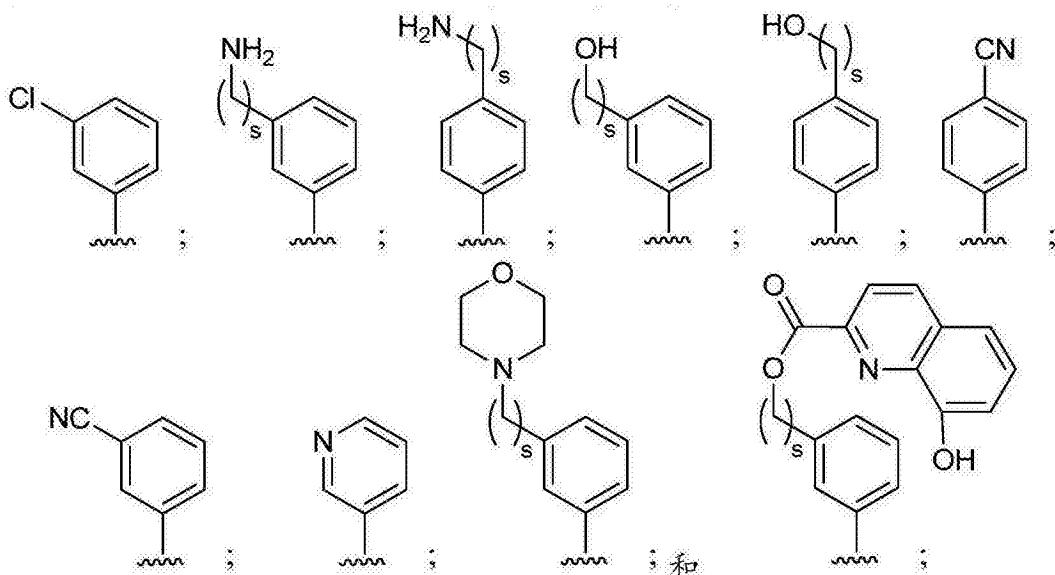
M1 为卤素,  $-CH_2OH$ , 或  $-OCH_3$ ；

X 为 O, S 或  $NR^{1c}$ , 其中  $R^{1c}$  为氢, 取代烷基, 或未取代烷基；

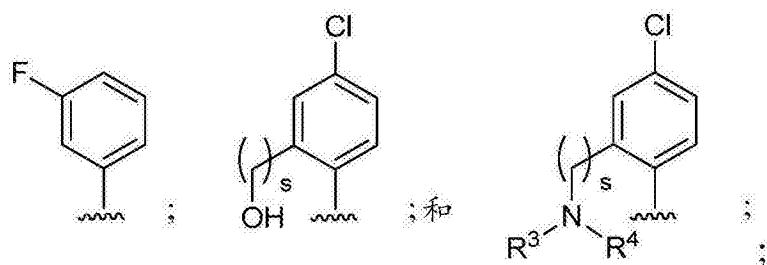
$R^1$ ,  $R^{1a}$ ,  $R^{1b}$ ,  $R^2$  和  $R^5$  独立地为氢, OH,  $NH_2$ , SH, CN,  $NO_2$ ,  $SO_2$ ,  $OSO_2OH$ ,  $OSO_2NH_2$ , 取代或未取代环烷基, 取代或未取代杂环烷基, 取代或未取代芳基, 或取代或未取代杂芳基；

$R^*$  为取代或未取代芳基, 取代或未取代芳烷基, 取代或未取代杂芳基, 取代或未取代杂芳烷基, 或取代或未取代乙烯基；

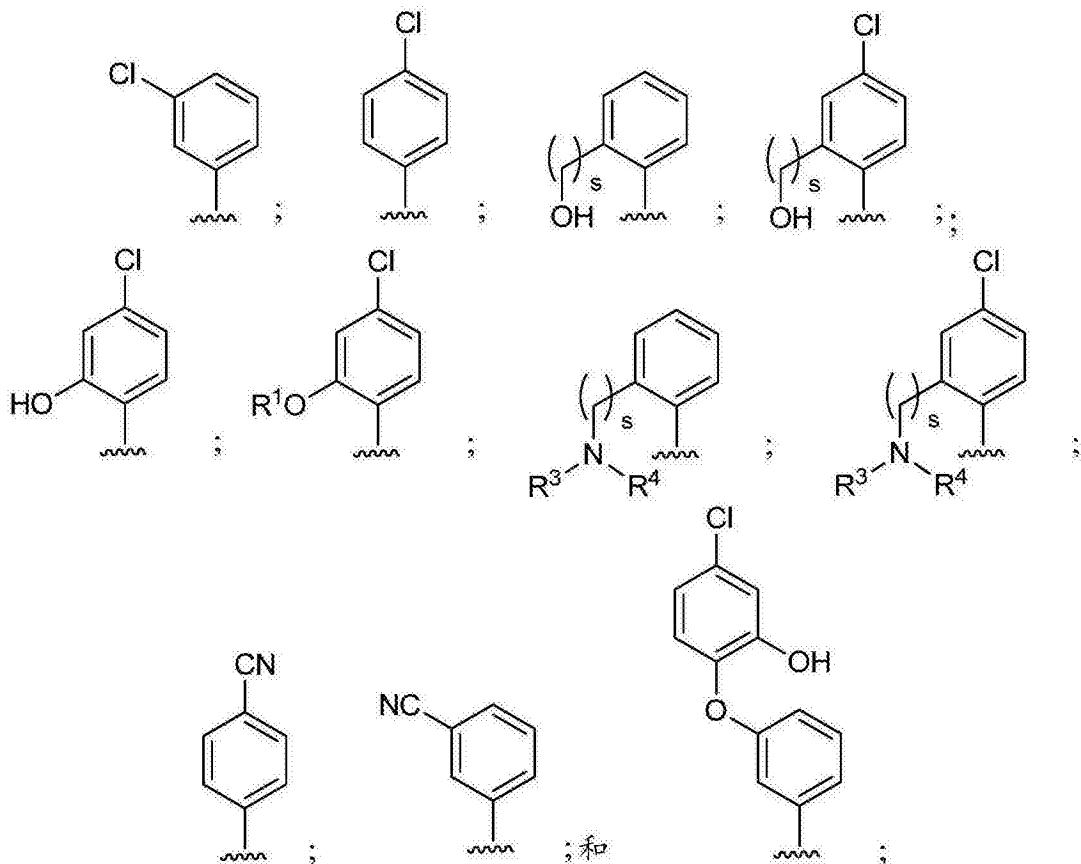
条件是当 M 为 F 时,  $R^*$  不选自以下中的单元：



并且条件是当 M 为 Cl 时,  $R^*$  不选自以下中的单元：

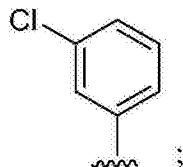


并且条件是当 M 为氢时, R\* 不选自以下中的单元 :

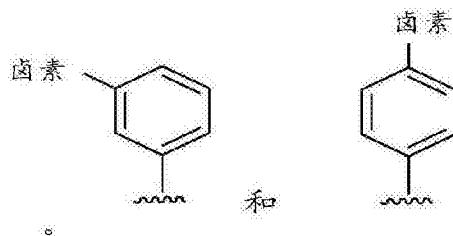


其中 s = 1 或 2 ;R<sup>3</sup>和 R<sup>4</sup>独立地为甲基或乙基 ;

并且条件是当 M 为 OCH<sub>3</sub>时, R\* 不选自以下中的单元 :



并且条件是当 M<sup>1</sup>为 F 时, R\* 不选自以下中的单元 :



2. 权利要求 1 的方法, 其中所述病原体选自 : 支顶孢菌属 (Acremonium spp.), 白锈属 (Albugo spp.), 链格孢属 (Alternaria spp.), 壳二孢属 (Ascochyta spp.), 曲霉属 (Aspergillus spp.), 球二孢属 (Botryodiplodia spp.), 葡萄座腔菌属 (Botryosphaeria spp.), 葡萄孢属 (Botrytis spp.), 丝衣霉属 (Byssochlamys spp.), 念珠菌属 (candida spp.), 头孢霉属 (Cephalosporium spp.), 长喙壳菌属 (Ceratocystis spp.), 尾孢属 (Cercospora spp.), 横节霉菌属 (Chalara spp.), 有枝孢属 (Cladosporium spp.), 刺盘孢属 (Colletotrichum spp.), 拟隐抱壳属 (Cryptosporiopsis spp.), 人参生柱隔孢属

(*Cylindrocarpon* spp.), 德巴利酵母属 (*Debaryomyces* spp.), 北茎溃疡菌属 (*Diaporthe* spp.), 亚隔孢壳属 (*Didymella* spp.), 色二孢属 (*Diplodia* spp.), 小穴壳属 (*Dothiorella* spp.), 疣囊腔菌属 (*Elsinoe* spp.), 镰刀菌属 (*Fusarium* spp.), 地菌属 (*Geotrichum* spp.), 盘长孢属 (*Gloeosporium* spp.), 围小丛壳菌属 (*Glomerella* spp.), 长螺孢菌属 (*Helminthosporium* spp.), *Khuskia* spp., 毛双孢属 (*Lasiodiplodia* spp.), 大茎点菌属 (*Macrophoma* spp.), 亚大茎点菌属 (*Macrophomina* spp.), 菜豆壳球孢属 (*Microdochium* spp.), 链核盘菌属 (*Monilinia* spp.), *Monilochaethes* spp., 毛霉菌属 (*Mucor* spp.), 中央孢子菌属 (*Mycocentrospora* spp.), 球腔菌属 (*Mycosphaerella* spp.), 丛赤壳属 (*Nectria* spp.), 明孢盘菌属 (*Neofabraea* spp.), 露疫霉属 (*Nigrospora* spp.), 青霉菌属 (*Penicillium* spp.), 荔枝霜疫霉属 (*Peronophthora* spp.), 霜霉菌属 (*Peronospora* spp.), 拟盘多毛孢属 (*Pestalotiopsis* spp.), 无柄盘菌属 (*Pezicula* spp.), 半知菌亚门球壳孢目星裂壳孢属 (*Phacidiopycnis* spp.), 茎点霉属 (*Phoma* spp.), 拟茎点霉属 (*Phomopsis* spp.), 叶点霉属 (*Phyllosticta* spp.), 疫病菌属 (*Phytophthora* spp.), 蛇孢霉属 (*Polyscytalum* spp.), 假尾孢属 (*Pseudocercospora* spp.), 稻瘟菌属 (*Pyricularia* spp.), 腐霉属 (*Pythium* spp.), 丝核菌属 (*Rhizoctonia* spp.), 根霉属 (*Rhizopus* spp.), 小菌核属 (*Sclerotium* spp.), 核盘菌属 (*Sclerotinia* spp.), 壳针孢属 (*Septoria* spp.), 葡萄痂圆孢菌属 (*Sphaceloma* spp.), *Sphaeropsis* spp., 铺柄霉属 (*Stemphyllium* spp.), *Stilbella* spp., 根串珠霉菌属 (*Thielaviopsis* spp.), *Thyronectria* spp., *Trachysphaera* spp., 单孢锈菌属 (*Uromyces* spp.), 黑粉菌属 (*Ustilago* spp.), 黑星病菌属 (*Venturia* spp.), 和轮枝孢属 (*Verticillium* spp.)。

3. 权利要求 1 的方法, 其中所述病原体选自: 欧文氏菌属 (*Erwinia* spp.), 泛菌属 (*Pantoea* spp.), *Pectobacterium* spp., 假单胞菌属 (*Pseudomonas* spp.), 萎焉 (*Ralstonia* spp.), 黄单胞菌属 (*Xanthomonas* spp.); 沙门氏菌属 (*Salmonella* spp.), 大肠杆菌属 (*Escherichia* spp.), 乳杆菌属 (*Lactobacillus* spp.), 明串珠菌属 (*Leuconostoc* spp.), 李斯特菌属 (*Listeria* spp.), 志贺菌属 (*Shigella* spp.), 葡萄球菌属 (*Staphylococcus* spp.), 念珠菌属 (*candida* spp.), 德巴利氏酵母属 (*Debaryomyces* spp.), 芽孢杆菌属 (*Bacillus* spp.), 弯曲菌属 (*Campylobacter* spp.), 棒形杆菌属 (*Clavibacter* spp.), 梭状芽孢杆菌属 (*Clostridium* spp.), 隐孢子虫属 (*Cryptosporidium* spp.), 贾第鞭毛虫属 (*Giardia* spp.), 弧菌属 (*Vibrio* spp.), 黄单胞菌属 (*Xanthomonas* spp.), 和尔森氏菌属 (*Yersinia* spp.)。

4. 权利要求 1 的方法, 其中所述方法包括收获前处理或收获后处理。

5. 权利要求 4 的方法, 其中所述收获前处理选自: 移植之前或之后的种子处理和移植处理。

6. 权利要求 4 的方法, 其中所述收获后处理选自: 现场包装期间的处理; 在货盘化期间或货盘化之后, 开口货盘中或包装货盘中, 帐篷中, 带衬垫或不带衬垫的箱式处理中, 运输期间使用的海上集装箱、卡车或其它集装箱类型中的处理; 和储存期间(正常气氛或受控气氛)和/或整个销售网络的处理。

7. 权利要求 1 的方法, 其中所述肉类、植物或植物部分包含转基因植物或转基因植物部分。

8. 权利要求 1 的方法, 其中所述肉类、植物或植物部分选自玉米, 小麦, 棉花, 稻, 大豆, 和低芥酸油菜。

9. 权利要求 1 的方法, 其中所述肉类、植物或植物部分选自水果, 蔬菜, 苗圃, 草坪, 和观赏作物。

10. 权利要求 1 的方法, 其中所述水果选自 :香蕉, 菠萝, 柑橘, 葡萄, 西瓜, 棱瓜, 香瓜, 和其它甜瓜, 苹果, 桃, 梨, 樱桃, 猕猴桃, 芒果, 油桃, 番石榴, 番木瓜, 柿子, 石榴, 油梨, 无花果, 柑橘, 和浆果。

11. 权利要求 10 的方法, 其中所述浆果选自草莓, 越橘, 覆盆子, 和黑莓, 所述柑橘选自 :橙, 柠檬, 酸柠檬, 和葡萄柚。

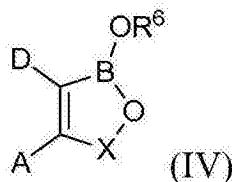
12. 权利要求 1 的方法, 其中所述接触包括通过选自以下的方式施用挥发性抗微生物化合物 :喷雾, 下雾, 热起雾或非热起雾, 浸湿, 气体处理, 及其组合。

13. 权利要求 12 的方法, 其中所述气体处理选自 :从香囊释放, 从合成膜或天然膜或纤维材料释放, 从衬垫或其它包装材料释放, 从粉剂释放, 从释放气体的发生器释放, 使用压缩气瓶或非压缩气瓶释放, 从箱内的液滴释放, 及其组合。

14. 权利要求 1 的方法, 其进一步包括将所述肉类、植物或植物部分与环丙烯化合物接触。

15. 权利要求 14 的方法, 其中所述环丙烯化合物含有 1- 甲基环丙烯 (1-MCP)。

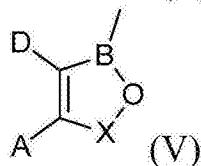
16. 使用挥发性抗微生物化合物抵抗影响肉类、植物或植物部分的病原体的方法, 其包括将所述肉类、植物或植物部分与有效量的式 (IV) 的挥发性抗微生物化合物及其农用盐接触 :



其中 A 和 D 与它们所连接的碳原子共同形成 5-、6- 或 7- 元稠环, 所述稠环可以由以下基团取代 :C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷氧基, 羟基, 卤素, 硝基, 脂基, 氨基, 由一个或多个 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷基取代的氨基, 羧基, 酰基, 芳氧基, 碳酰胺基, 由 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷基取代的碳酰胺基, 磺酰胺基或三氟甲基, 或所述稠环可以连接两个氧硼环戊环 ;

X 为基团 -CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, 其中 R<sup>7</sup>和 R<sup>8</sup>各自独立地为氢, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷基, 脂基, 硝基, 芳基, 芳烷基, 或 R<sup>7</sup>和 R<sup>8</sup>与它们所连接的碳原子共同形成脂环 ; 和

R<sup>6</sup>为氢, C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>- 烷基, 由 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷氧基取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>- 烷基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷硫基, 羟基, 氨基, 由 C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>- 烷基取代的氨基, 羧基, 芳基, 芳氧基, 碳酰胺基, 由 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷基取代的碳酰胺基, 芳基或芳烷基, 芳烷基, 芳基, 杂芳基, 环烷基, C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>- 亚烷基氨基, 由苯基取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>- 亚烷基氨基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷氧基或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷硫基, 羰基亚烷基氨基或式 (V) 基团 :



其中 A、D 和 X 为前文中定义, 不同之处在 2-(羟甲基) 苯硼酸环状单酯

(boronophthalide)。

17. 权利要求 16 的方法,其中所述病原体选自:支顶孢菌属 (*Acremonium* spp.), 白锈属 (*Albugo* spp.), 链格孢属 (*Alternaria* spp.), 壳二孢属 (*Ascochyta* spp.), 曲霉属 (*Aspergillus* spp.), 球二孢属 (*Botryodiplodia* spp.), 葡萄座腔菌属 (*Botryosphaeria* spp.), 葡萄孢属 (*Botrytis* spp.), 丝衣霉属 (*Byssochlamys* spp.), 念珠菌属 (*candida* spp.), 头孢霉属 (*Cephalosporium* spp.), 长喙壳菌属 (*Ceratocystis* spp.), 尾孢属 (*Cercospora* spp.), 横节霉菌属 (*Chalara* spp.), 有枝孢属 (*Cladosporium* spp.), 刺盘孢属 (*Colletotrichum* spp.), 拟隐抱壳属 (*Cryptosporiopsis* spp.), 人参生柱隔孢属 (*Cylindrocarpon* spp.), 德巴利酵母属 (*Debaryomyces* spp.), 北茎溃疡菌属 (*Diaporthe* spp.), 亚隔孢壳属 (*Didymella* spp.), 色二孢属 (*Diplodia* spp.), 小穴壳属 (*Dothiorella* spp.), 痢囊腔菌属 (*Elsinoe* spp.), 镰刀菌属 (*Fusarium* spp.), 地菌属 (*Geotrichum* spp.), 盘长孢属 (*Gloeosporium* spp.), 围小丛壳菌属 (*Glomerella* spp.), 长螺孢菌属 (*Helminthosporium* spp.), *Khuskia* spp., 毛双孢属 (*Lasiodiplodia* spp.), 大茎点菌属 (*Macrophoma* spp.), 亚大茎点菌属 (*Macrophomina* spp.), 菜豆壳球孢属 (*Microdochium* spp.), 链核盘菌属 (*Monilinia* spp.), *Monilochaethes* spp., 毛霉菌属 (*Mucor* spp.), 中央孢子菌属 (*Mycocentrospora* spp.), 球腔菌属 (*Mycosphaerella* spp.), 丛赤壳属 (*Nectria* spp.), 明孢盘菌属 (*Neofabraea* spp.), 露疫霉属 (*Nigrospora* spp.), 青霉菌属 (*Penicillium* spp.), 荔枝霜疫霉属 (*Peronophthora* spp.), 霜霉菌属 (*Peronospora* spp.), 拟盘多毛孢属 (*Pestalotiopsis* spp.), 无柄盘菌属 (*Pezicula* spp.), 半知菌亚门球壳孢目星裂壳孢属 (*Phacidiopycnis* spp.), 茎点霉属 (*Phoma* spp.), 拟茎点霉属 (*Phomopsis* spp.), 叶点霉属 (*Phyllosticta* spp.), 疫病菌属 (*Phytophthora* spp.), 蛇孢霉属 (*Polyscytalum* spp.), 假尾孢属 (*Pseudocercospora* spp.), 稻瘟菌属 (*Pyricularia* spp.), 腐霉属 (*Pythium* spp.), 丝核菌属 (*Rhizoctonia* spp.), 根霉属 (*Rhizopus* spp.), 小菌核属 (*Sclerotium* spp.), 核盘菌属 (*Sclerotinia* spp.), 壳针孢属 (*Septoria* spp.), 葡萄痂圆孢菌属 (*Sphaceloma* spp.), (*Sphaeropsis* spp.), 披柄霉属 (*Stemphyllium* spp.), *Stilbella* spp., 根串珠霉菌属 (*Thielaviopsis* spp.), *Thyronectria* spp., *Trachysphaera* spp., 单孢锈菌属 (*Uromyces* spp.), 黑粉菌属 (*Ustilago* spp.), 黑星病菌属 (*Venturia* spp.), 和轮枝孢属 (*Verticillium* spp.)。

18. 权利要求 16 的方法,其中所述病原体选自:欧文氏菌属 (*Erwinia* spp.), 泛菌属 (*Pantoea* spp.), *Pectobacterium* spp., 假单胞菌属 (*Pseudomonas* spp.), 萎焉 (*Ralstonia* spp.), 黄单胞菌属 (*Xanthomonas* spp.); 沙门氏菌属 (*Salmonella* spp.), 大肠杆菌属 (*Escherichia* spp.), 乳杆菌属 (*Lactobacillus* spp.), 明串珠菌属 (*Leuconostoc* spp.), 李斯特菌属 (*Listeria* spp.), 志贺菌属 (*Shigella* spp.), 葡萄球菌属 (*Staphylococcus* spp.), 念珠菌属 (*candida* spp.), 德巴利氏酵母属 (*Debaryomyces* spp.), 芽孢杆菌属 (*Bacillus* spp.), 弯曲菌属 (*Campylobacter* spp.), 棒形杆菌属 (*Clavibacter* spp.), 梭状芽孢杆菌属 (*Clostridium* spp.), 隐孢子虫属 (*Cryptosporidium* spp.), 贾第鞭毛虫属 (*Giardia* spp.), 弧菌属 (*Vibrio* spp.), 黄单胞菌属 (*Xanthomonas* spp.), 和尔森氏菌属 (*Yersinia* spp.)。

19. 权利要求 16 的方法,其中所述方法包括收获前处理或收获后处理。

20. 权利要求 19 的方法, 其中所述收获前处理选自 : 移植之前或之后的种子处理和移植处理。

21. 权利要求 19 的方法, 其中所述收获后处理选自 : 现场包装期间的处理 ; 在货盘化期间或货盘化之后的处理, 开口货盘中或包装货盘中, 帐篷中, 带衬垫或不带衬垫的箱式处理中, 运输期间使用的海上集装箱、卡车或其它集装箱类型中, 和储存期间 ( 正常气氛或受控气氛 ) 和 / 或整个销售网络的处理。

22. 权利要求 16 的方法, 其中所述肉类、植物或植物部分包含转基因植物或转基因植物部分。

23. 权利要求 16 的方法, 其中所述肉类、植物或植物部分选自玉米, 小麦, 棉花, 稻, 大豆, 和低芥酸油菜。

24. 权利要求 16 的方法, 其中所述肉类、植物或植物部分选自水果, 蔬菜, 苗圃, 草坪, 和观赏作物。

25. 权利要求 16 的方法, 其中所述水果选自 : 香蕉, 菠萝, 柑橘, 葡萄, 西瓜, 棱瓜, 香瓜, 和其它甜瓜, 苹果, 桃, 梨, 樱桃, 猕猴桃, 芒果, 油桃, 番石榴, 番木瓜, 柿子, 石榴, 油梨, 无花果, 柑橘, 和浆果。

26. 权利要求 25 的方法, 其中所述浆果选自草莓, 越橘, 覆盆子, 和黑莓, 所述柑橘选自 : 橙, 柠檬, 酸柠檬, 和葡萄柚。

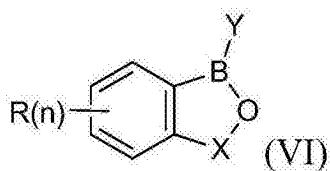
27. 权利要求 16 的方法, 其中所述接触包括通过选自以下的方式施用挥发性抗微生物化合物 : 喷雾, 下雾, 热起雾或非热起雾, 浸湿, 气体处理, 及其组合。

28. 权利要求 27 的方法, 其中所述气体处理选自 : 从香囊释放, 从合成膜或天然膜释放, 从衬垫或其它包装材料释放, 从粉剂释放, 从释放气体的发生器释放, 使用压缩气瓶或非压缩气瓶释放, 从箱内的液滴释放, 及其组合。

29. 权利要求 16 的方法, 其进一步包括将所述肉类、植物、植物部分与环丙烯化合物接触。

30. 权利要求 29 的方法, 其中所述环丙烯化合物含有 1- 甲基环丙烯 (1-MCP)。

31. 使用挥发性抗微生物化合物抵抗影响肉类、植物或植物部分的病原体的方法, 包括将所述肉类、植物或植物部分与有效量的式 (VI) 的挥发性抗微生物化合物及其农用盐接触 :



其中每个 R 独立地为氢, 烷基, 烯, 炔, 卤代烷基, 卤代烯基, 卤代炔基, 烷氧基, 烯氧基, 卤代烷氧基, 芳基, 杂芳基, 芳烷基, 芳基烯基, 芳基炔基, 杂芳烷基, 杂芳基烯基, 杂芳基炔基, 卤素, 羟基, 脂基, 胺, 酯, 羧酸, 酮, 醇, 硫醚, 亚砜, 硫, 硫基肟, 硫亚胺, 硫酰胺, 硫酸酯, 硫酸酯, 硫基烷基, 硫酰胺, 肟, 亚胺, 羟基胺, 肽, 脲, 氨基甲酸酯, 硫代氨基甲酸酯, 脲, 硫脲, 碳酸酯, 芳氧基, 或杂芳基氧基 ;

n = 1, 2, 3, 或 4 ;

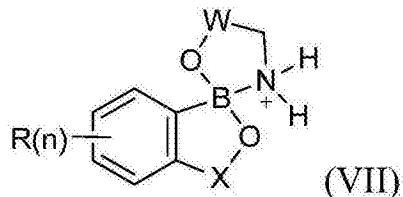
B 为硼 ;

$X = (\text{CR}_2)_m$ , 其中  $m = 1, 2, 3$ , 或 4;

$Y$  为烷基, 烯, 炔, 卤代烷基, 卤代烯基, 卤代炔基, 烷氧基, 烯氧基, 卤代烷氧基, 芳基, 杂芳基, 芳烷基, 芳基烯基, 芳基炔基, 杂芳烷基, 杂芳基烯基, 杂芳基炔基, 羟基, 腈基, 胺, 酯, 羧酸, 酮, 醇, 硫醚, 亚砜, 砜, 磺基肟, 硫亚胺, 磺酰胺, 硫酸酯, 磺酸酯, 硝基烷基, 酰胺, 脲, 亚胺, 羟基胺, 肽, 肽, 氨基甲酸酯, 硫代氨基甲酸酯, 脲, 硫脲, 碳酸酯, 芳氧基, 或杂芳基氨基;

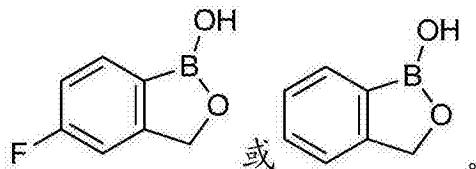
条件是当  $Y$  为羟基时,  $R$  不是芳氧基, 或杂芳基氨基。

32. 权利要求 31 的方法, 其中挥发性抗微生物化合物具有式 (VII) 的结构:



其中  $W = (\text{CH}_2)_q$ , 其中  $q = 1, 2$ , 或 3。

33. 权利要求 31 的方法, 其中挥发性抗微生物化合物具有以下结构:



34. 权利要求 31 的方法, 其中所述病原体选自: 支顶孢菌属 (*Acremonium* spp.), 白锈属 (*Albugo* spp.), 链格孢属 (*Alternaria* spp.), 壳二孢属 (*Ascochyta* spp.), 曲霉属 (*Aspergillus* spp.), 球二孢属 (*Botryodiplodia* spp.), 葡萄座腔菌属 (*Botryosphaeria* spp.), 葡萄孢属 (*Botrytis* spp.), 丝衣霉属 (*Byssochlamys* spp.), 念珠菌属 (*candida* spp.), 头孢霉属 (*Cephalosporium* spp.), 长喙壳菌属 (*Ceratocystis* spp.), 尾孢属 (*Cercospora* spp.), 横节霉菌属 (*Chalara* spp.), 有枝孢属 (*Cladosporium* spp.), 刺盘孢属 (*Colletotrichum* spp.), 拟隐抱壳属 (*Cryptosporiopsis* spp.), 人参生柱隔孢属 (*Cylindrocarpon* spp.), 德巴利酵母属 (*Debaryomyces* spp.), 北茎溃疡菌属 (*Diaporthe* spp.), 亚隔孢壳属 (*Didymella* spp.), 色二孢属 (*Diplodia* spp.), 小穴壳属 (*Dothiorella* spp.), 瘤囊腔菌属 (*Elsinoe* spp.), 镰刀菌属 (*Fusarium* spp.), 地菌属 (*Geotrichum* spp.), 盘长孢属 (*Gloeosporium* spp.), 围小丛壳菌属 (*Glomerella* spp.), 长螺孢菌属 (*Helminthosporium* spp.), *Khuskia* spp., 毛双孢属 (*Lasiodiplodia* spp.), 大茎点菌属 (*Macrophoma* spp.), 亚大茎点菌属 (*Macrohomina* spp.), 菜豆壳球孢属 (*Microdochium* spp.), 链核盘菌属 (*Monilinia* spp.), (*Monilochaethes* spp.), 毛霉菌属 (*Mucor* spp.), 中央孢子菌属 (*Mycocentrospora* spp.), 球腔菌属 (*Mycosphaerella* spp.), 丛赤壳属 (*Nectria* spp.), 明孢盘菌属 (*Neofabraea* spp.), 露疫霉属 (*Nigrospora* spp.), 青霉菌属 (*Penicillium* spp.), 荔枝霜疫霉属 (*Peronophthora* spp.), 霜霉菌属 (*Peronospora* spp.), 拟盘多毛孢属 (*Pestalotiopsis* spp.), 无柄盘菌属 (*Pezicula* spp.), 半知菌亚门球壳孢目星裂壳孢属 (*Phacidiopycnis* spp.), 茎点霉属 (*Phoma* spp.), 拟茎点霉属 (*Phomopsis* spp.), 叶点霉属 (*Phyllosticta* spp.), 疫病菌属 (*Phytophthora* spp.), 蛇孢

霉属 (*Polyscytalum* spp.), 假尾孢属 (*Pseudocercospora* spp.), 稻瘟菌属 (*Pyricularia* spp.), 腐霉属 (*Pythium* spp.), 丝核菌属 (*Rhizoctonia* spp.), 根霉属 (*Rhizopus* spp.), 小菌核属 (*Sclerotium* spp.), 核盘菌属 (*Sclerotinia* spp.), 壳针孢属 (*Septoria* spp.), 葡萄痂圆孢菌属 (*Sphaeloma* spp.), (*Sphaeropsis* spp.), 铜柄霉属 (*Stemphyllium* spp.), *Stilbella* spp., 根串珠霉菌属 (*Thielaviopsis* spp.), *Thyronectria* spp., *Trachysphaera* spp., 单孢锈菌属 (*Uromyces* spp.), 黑粉菌属 (*Ustilago* spp.), 黑星病菌属 (*Venturia* spp.), 和轮枝孢属 (*Verticillium* spp.)。

35. 权利要求 31 的方法, 其中所述病原体选自 : 欧文氏菌属 (*Erwinia* spp.), 泛菌属 (*Pantoea* spp.), *Pectobacterium* spp., 假单胞菌属 (*Pseudomonas* spp.), 萎焉 (*Ralstonia* spp.), 黄单胞菌属 (*Xanthomonas* spp.); 沙门氏菌属 (*Salmonella* spp.), 大肠杆菌属 (*Escherichia* spp.), 乳杆菌属 (*Lactobacillus* spp.), 明串珠菌属 (*Leuconostoc* spp.), 李斯特菌属 (*Listeria* spp.), 志贺菌属 (*Shigella* spp.), 葡萄球菌属 (*Staphylococcus* spp.), 念珠菌属 (*candida* spp.), 德巴利氏酵母属 (*Debaryomyces* spp.), 芽孢杆菌属 (*Bacillus* spp.), 弯曲菌属 (*Campylobacter* spp.), 棒形杆菌属 (*Clavibacter* spp.), 梭状芽孢杆菌属 (*Clostridium* spp.), 隐孢子虫属 (*Cryptosporidium* spp.), 贾第鞭毛虫属 (*Giardia* spp.), 弧菌属 (*Vibrio* spp.), 黄单胞菌属 (*Xanthomonas* spp.), 和尔森氏菌属 (*Yersinia* spp.)。

36. 权利要求 31 的方法, 其中所述方法包括收获前处理或收获后处理。

37. 权利要求 36 的方法, 其中所述收获前处理选自 : 移植之前或之后的种子处理和移植处理。

38. 权利要求 36 的方法, 其中所述收获后处理选自 : 现场包装期间的处理 ; 在货盘化期间或货盘化之后, 开口货盘中或包装货盘中, 帐篷中, 带衬垫或不带衬垫的箱式处理中, 运输期间使用的海上集装箱、卡车或其它集装箱类型中的处理 ; 和储存期间 ( 正常气氛或受控气氛 ) 和 / 或整个销售网络的处理。

39. 权利要求 31 的方法, 其中所述肉类、植物或植物部分包含转基因植物或转基因植物部分。

40. 权利要求 31 的方法, 其中所述肉类、植物或植物部分选自玉米, 小麦, 棉花, 稻, 大豆, 和低芥酸油菜。

41. 权利要求 31 的方法, 其中所述肉类、植物或植物部分选自水果, 蔬菜, 苗圃, 草坪, 和观赏作物。

42. 权利要求 31 的方法, 其中所述水果选自 : 香蕉, 菠萝, 柑橘, 葡萄, 西瓜, 棱瓜, 香瓜, 和其它甜瓜, 苹果, 桃, 梨, 樱桃, 猕猴桃, 芒果, 油桃, 番石榴, 番木瓜, 柿子, 石榴, 油梨, 无花果, 柑橘, 和浆果。

43. 权利要求 42 的方法, 其中所述浆果选自草莓, 越橘, 覆盆子, 和黑莓, 所述柑橘选自 : 橙, 柠檬, 酸柠檬, 和葡萄柚。

44. 权利要求 31 的方法, 其中所述接触包括通过选自以下的方式施用挥发性抗微生物化合物 : 喷雾, 下雾, 热起雾或非热起雾, 浸湿, 气体处理, 及其组合。

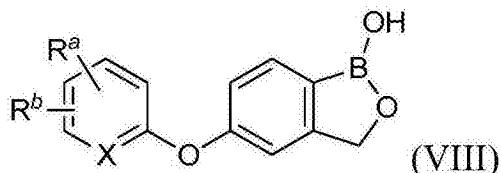
45. 权利要求 44 的方法, 其中所述气体处理选自 : 从香囊释放, 从合成膜或天然膜释放, 从衬垫或其它包装材料释放, 从粉剂释放, 从释放气体的发生器释放, 使用压缩气瓶或

非压缩气瓶释放,从箱内的液滴释放,及其组合。

46. 权利要求 31 的方法,其进一步包括将所述肉类、植物、植物部分与环丙烯化合物接触。

47. 权利要求 46 的方法,其中所述环丙烯化合物含有 1- 甲基环丙烯 (1-MCP)。

48. 使用挥发性抗微生物化合物抵抗影响肉类、植物或植物部分的病原体的方法,包括将所述肉类、植物或植物部分与有效量的式 (VIII) 的挥发性抗微生物化合物及其农用盐接触:



其中 R<sup>a</sup>为 CN, C(O)NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>或 C(O)OR<sup>11</sup>, 其中 R<sup>11</sup>为氢, 取代烷基, 或未取代烷基,

X 为 N, CH 和 CR<sup>b</sup>;

R<sup>b</sup>为卤素, 取代或未取代烷基, C(O)R<sup>12</sup>, C(O)OR<sup>12</sup>, OR<sup>12</sup>, NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, 其中 R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup>, R<sup>12</sup>, 和 R<sup>13</sup>独立地为氢, 取代或未取代烷基, 取代或未取代杂烷基, 取代或未取代环烷基, 取代或未取代杂环烷基, 取代或未取代芳基, 或取代或未取代杂芳基;

条件是 R<sup>9</sup>和 R<sup>10</sup>, 与它们所连接的碳, 任选地组合形成 4- 至 8- 元取代或未取代杂环烷基环;

并且条件是 R<sup>12</sup>和 R<sup>13</sup>, 与它们所连接的碳, 任选地组合形成 4- 至 8- 元取代或未取代杂环烷基环。

49. 权利要求 48 的方法,其中所述病原体选自: 支顶孢菌属 (*Acremonium* spp.), 白锈属 (*Albugo* spp.), 链格孢属 (*Alternaria* spp.), 壳二孢属 (*Ascochyta* spp.), 曲霉属 (*Aspergillus* spp.), 球二孢属 (*Botryodiplodia* spp.), 葡萄座腔菌属 (*Botryosphaeria* spp.), 葡萄孢属 (*Botrytis* spp.), 丝衣霉属 (*Byssochlamys* spp.), 念珠菌属 (*candida* spp.), 头孢霉属 (*Cephalosporium* spp.), 长喙壳菌属 (*Ceratocystis* spp.), 尾孢属 (*Cercospora* spp.), 横节霉菌属 (*Chalara* spp.), 有枝孢属 (*Cladosporium* spp.), 刺盘孢属 (*Colletotrichum* spp.), 拟隐抱壳属 (*Cryptosporiopsis* spp.), 人参柱隔孢属 (*Cylindrocarpon* spp.), 德巴利酵母属 (*Debaryomyces* spp.), 北茎溃疡菌属 (*Diaporthe* spp.), 亚隔孢壳属 (*Didymella* spp.), 色二孢属 (*Diplodia* spp.), 小穴壳属 (*Dothiorella* spp.), 瘤囊腔菌属 (*Elsinoe* spp.), 镰刀菌属 (*Fusarium* spp.), 地菌属 (*Geotrichum* spp.), 盘长孢属 (*Gloeosporium* spp.), 围小丛壳菌属 (*Glomerella* spp.), 长螺孢菌属 (*Helminthosporium* spp.), *Khuskia* spp., 毛双孢属 (*Lasiodiplodia* spp.), 大茎点菌属 (*Macrophoma* spp.), 亚大茎点菌属 (*Macrohomina* spp.), 菜豆壳球孢属 (*Microdochium* spp.), 链核盘菌属 (*Monilinia* spp.), (*Monilochaethes* spp.), 毛霉菌属 (*Mucor* spp.), 中央孢子菌属 (*Mycocentrospora* spp.), 球腔菌属 (*Mycosphaerella* spp.), 丛赤壳属 (*Nectria* spp.), 明孢盘菌属 (*Neofabraea* spp.), 露疫霉属 (*Nigrospora* spp.), 青霉菌属 (*Penicillium* spp.), 荔枝霜疫霉属 (*Peronophthora* spp.), 霜霉菌属 (*Peronospora* spp.), 拟盘多毛孢属 (*Pestalotiopsis* spp.), 无柄盘菌属 (*Pezicula* spp.), 半知菌亚门球壳孢目星裂壳孢属 (*Phacidiohypcnis* spp.), 茎点霉属 (*Phoma* spp.), 拟茎点霉属

(Phomopsis spp.), 叶点霉属(Phyllosticta spp.), 疫病菌属(Phytophthora spp.), 蛇孢霉属(Polyscytalum spp.), 假尾孢属(Pseudocercospora spp.), 稻瘟菌属(Pyricularia spp.), 腐霉属(Pythium spp.), 丝核菌属(Rhizoctonia spp.), 根霉属(Rhizopus spp.), 小菌核属(Sclerotium spp.), 核盘菌属(Sclerotinia spp.), 壳针孢属(Septoria spp.), 葡萄痂圆孢菌属(Sphaceloma spp.), (Sphaeropsis spp.), 铜柄霉属(Stemphyllium spp.), Stilbella spp., 根串珠霉菌属(Thielaviopsis spp.), Thronectria spp., Trachysphaera spp., 单孢锈菌属(Uromyces spp.), 黑粉菌属(Ustilago spp.), 黑星病菌属(Venturia spp.), 和轮枝孢属(Verticillium spp.)。

50. 权利要求 48 的方法, 其中所述病原体选自: 欧文氏菌属(Erwinia spp.), 泛菌属(Pantoea spp.), Pectobacterium spp., 假单胞菌属(Pseudomonas spp.), 萎焉(Ralstonia spp.), 黄单胞菌属(Xanthomonas spp.); 沙门氏菌属(Salmonella spp.), 大肠杆菌属(Escherichia spp.), 乳杆菌属(Lactobacillus spp.), 明串珠菌属(Leuconostoc spp.), 李斯特菌属(Listeria spp.), 志贺菌属(Shigella spp.), 葡萄球菌属(Staphylococcus spp.), 念珠菌属(candida spp.), 德巴利氏酵母属(Debaryomyces spp.), 芽孢杆菌属(Bacillus spp.), 弯曲菌属(Campylobacter spp.), 棒形杆菌属(Clavibacter spp.), 梭状芽孢杆菌属(Clostridium spp.), 隐孢子虫属(Cryptosporidium spp.), 贾第鞭毛虫属(Giardia spp.), 弧菌属(Vibrio spp.), 黄单胞菌属(Xanthomonas spp.), 和尔森氏菌属(Yersinia spp.)。

51. 权利要求 48 的方法, 其中所述方法包括收获前处理或收获后处理。

52. 权利要求 51 的方法, 其中所述收获前处理选自: 移植之前或之后的种子处理和移植处理。

53. 权利要求 51 的方法, 其中所述收获后处理选自: 现场包装期间的处理; 在货盘化期间或货盘化之后, 开口货盘中或包装货盘中, 帐篷中, 带衬垫或不带衬垫的箱式处理中, 运输期间使用的海上集装箱、卡车或其它集装箱类型中的处理, 和储存期间(正常气氛或受控气氛)和/或整个销售网络的处理。

54. 权利要求 48 的方法, 其中所述肉类、植物或植物部分包含转基因植物或转基因植物部分。

55. 权利要求 48 的方法, 其中所述肉类、植物或植物部分选自玉米, 小麦, 棉花, 稻, 大豆, 和低芥酸油菜。

56. 权利要求 48 的方法, 其中所述肉类、植物或植物部分选自水果, 蔬菜, 苗圃, 草坪, 和观赏作物。

57. 权利要求 48 的方法, 其中所述水果选自: 香蕉, 菠萝, 柑橘, 葡萄, 西瓜, 棱瓜, 香瓜, 和其它甜瓜, 苹果, 桃, 梨, 樱桃, 猕猴桃, 芒果, 油桃, 番石榴, 番木瓜, 柿子, 石榴, 油梨, 无花果, 柑橘, 和浆果。

58. 权利要求 57 的方法, 其中所述浆果选自草莓, 越橘, 覆盆子, 和黑莓, 所述柑橘选自: 橙, 柠檬, 酸柠檬, 和葡萄柚。

59. 权利要求 48 的方法, 其中所述接触包括通过选自以下的方式施用挥发性抗微生物化合物: 喷雾, 下雾, 热起雾或非热起雾, 浸湿, 气体处理, 及其组合。

60. 权利要求 59 的方法, 其中所述气体处理选自: 从香囊释放, 从合成膜或天然膜释

放,从衬垫或其它包装材料释放,从粉剂释放,从释放气体的发生器释放,使用压缩气瓶或非压缩气瓶释放,从箱内的液滴释放,及其组合。

61. 权利要求 48 的方法,其进一步包括将所述肉类、植物、植物部分与环丙烯化合物接触。

62. 权利要求 61 的方法,其中所述环丙烯化合物含有 1- 甲基环丙烯 (1-MCP)。

## 苯硼酸半酯作为挥发性抗微生物剂在肉类、植物或植物部 分上的用途

### 背景技术

[0001] 前述已披露了许多包含氧硼戊环 (oxaborole) 的化合物。但是，没有教导这些氧硼戊环化合物是挥发性抗微生物剂。另外，这些氧硼戊环化合物没有用于农业应用。

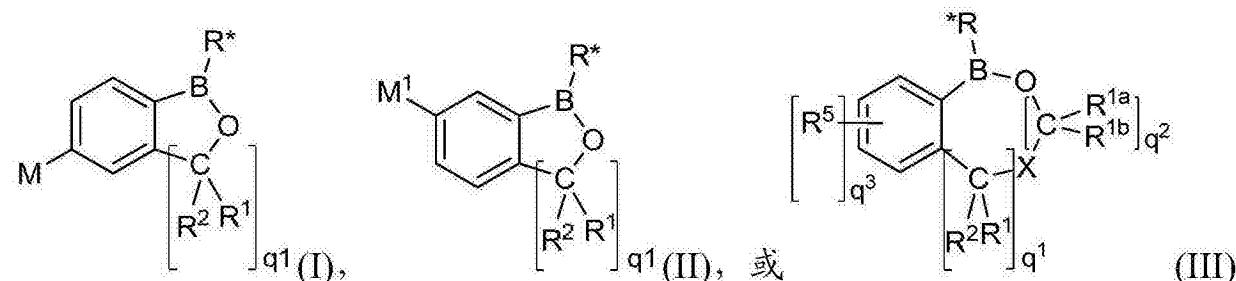
[0002] 因此，仍然需要开发各种挥发性抗微生物剂和 / 或与挥发性植物生长调节剂的组合在特别是农业应用中的新用途。

### 发明内容

[0003] 本发明涉及挥发性抗微生物化合物抵抗影响肉类、植物或植物部分的病原体的用途。提供的挥发性抗微生物化合物包括某些氧硼戊环化合物，例如苯硼酸半酯 (benzoxaboroles)。提供利用这些抗微生物化合物的挥发性质的递送系统。还披露了与挥发性植物生长调节剂，例如 1- 甲基环丙烯 (1-MCP) 的组合。

[0004] 一方面，提供使用挥发性抗微生物化合物抵抗影响肉类、植物或植物部分的病原体的方法。所述方法包括将所述肉类、植物或植物部分与有效量的具有式 (I)，(II) 或 (III) 结构的挥发性抗微生物化合物及其农用盐接触：

[0005]



[0006] 其中 q1 和 q2 独立地为 1, 2, 或 3；

[0007] q3 = 0, 1, 2, 3, 或 4；

[0008] M 为氢，卤素，-OCH<sub>3</sub>，或 -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>；

[0009] M1 为卤素，-CH<sub>2</sub>OH，或 -OCH<sub>3</sub>；

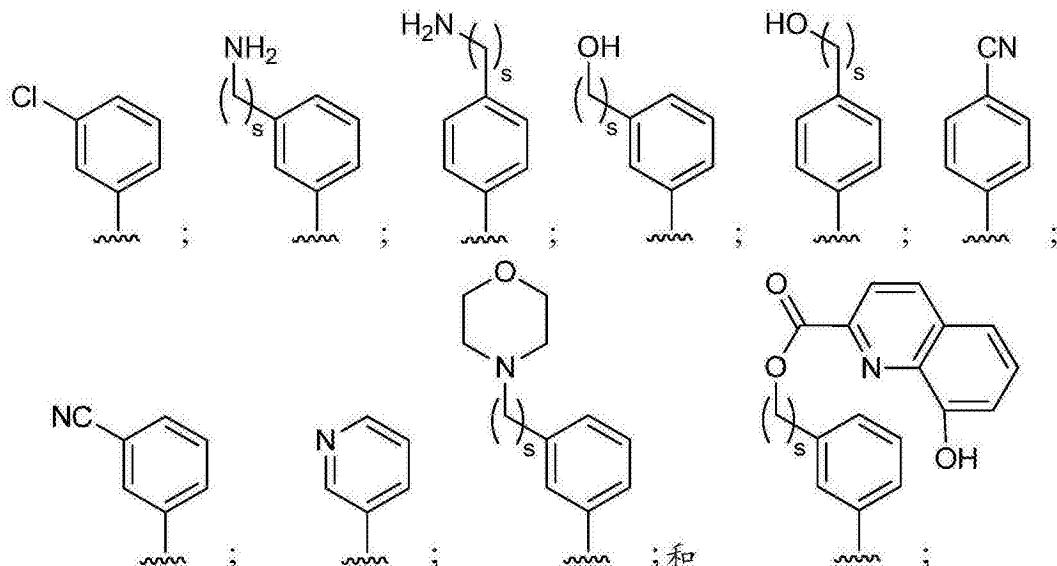
[0010] X 为 O, S, 或 NR<sup>1c</sup>, 其中 R<sup>1c</sup> 为氢, 取代烷基, 或未取代烷基；

[0011] R<sup>1</sup>, R<sup>1a</sup>, R<sup>1b</sup>, R<sup>2</sup>, 和 R<sup>5</sup> 独立地为氢, OH, NH<sub>2</sub>, SH, CN, NO<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>, OSO<sub>2</sub>OH, OSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, 取代或未取代环烷基, 取代或未取代杂环烷基, 取代或未取代芳基, 或取代或未取代杂芳基；

[0012] R\* 为取代或未取代芳基, 取代或未取代芳烷基, 取代或未取代杂芳基, 取代或未取代杂芳烷基, 或取代或未取代乙烯基；

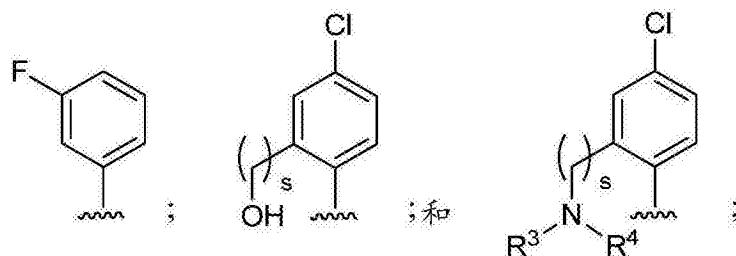
[0013] 条件是当 M 为 F 时, R\* 不选自以下中的单元：

[0014]



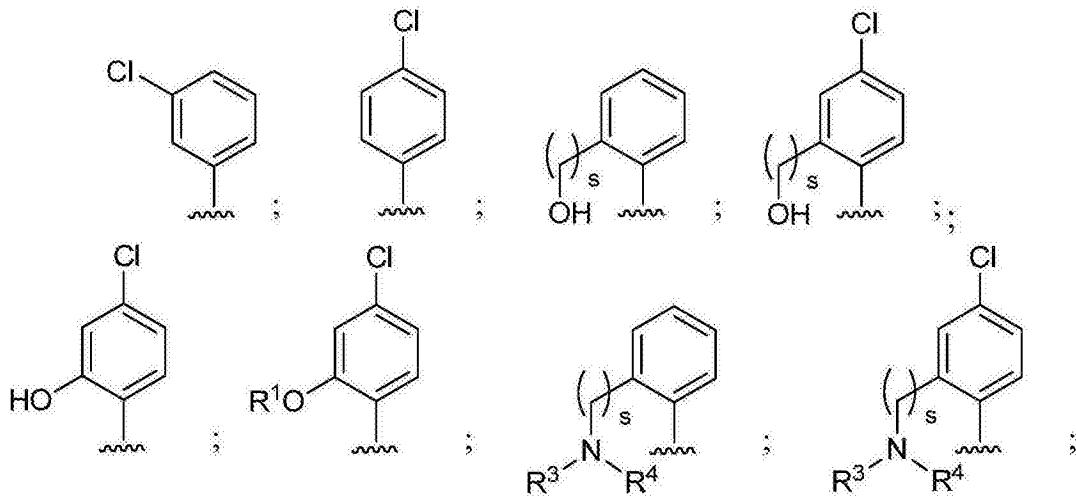
[0015] 并且条件是当 M 为 C1 时, R\* 不选自以下中的单元:

[0016]

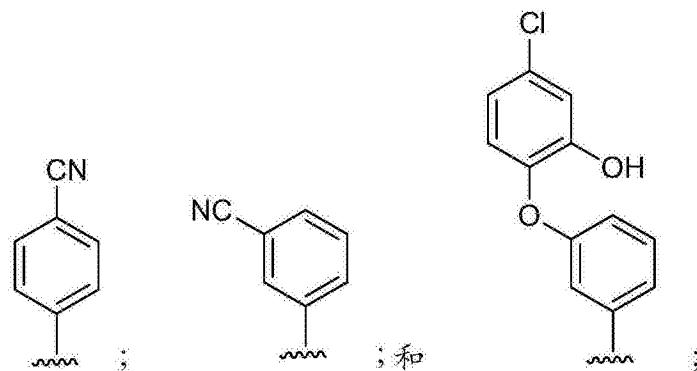


[0017] 并且条件是当 M 为氢时, R\* 不选自以下中的单元:

[0018]



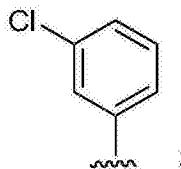
[0019]



[0020] 其中  $s = 1$  或  $2$ ;  $R^3$  和  $R^4$  独立地为甲基或乙基;

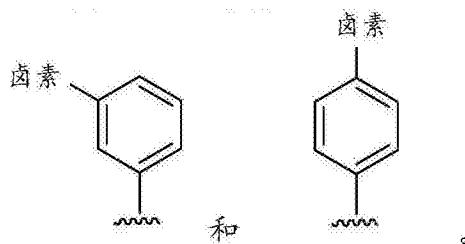
[0021] 并且条件是当  $M$  为  $OCH_3$  时,  $R^*$  不选自以下中的单元:

[0022]



[0023] 并且条件是当  $M^1$  为  $F$  时,  $R^*$  不选自以下中的单元:

[0024]



[0025] 在所提供的方法的一个实施方式中, 所述病原体选自: 链格孢属 (*Alternaria* spp.), 曲霉属 (*Aspergillus* spp.), 葡萄座腔菌属 (*Botryosphaeria* spp.), 葡萄孢属 (*Botrytis* spp.), 丝衣霉属 (*Byssochlamys* spp.), 刺盘孢属 (*Colletotrichum* spp.), 色二孢属 (*Diplodia* spp.), 镰刀菌属 (*Fusarium* spp.), 地菌属 (*Geotrichum* spp.), 毛双孢属 (*Lasiodiplodia* spp.), 链核盘菌属 (*Monilinia* spp.), 毛霉菌属 (*Mucor* spp.), 青霉菌属 (*Penicillium* spp.), 无柄盘菌属 (*Pezicula* spp.), 拟茎点霉属 (*Phomopsis* spp.), 疫病菌属 (*Phytophthora* spp.), 腐霉属 (*Pythium* spp.), 丝核菌属 (*Rhizoctonia* spp.), 根霉属 (*Rhizopus* spp.), 核盘菌属 (*Sclerotinia* spp.), 和 黑星病菌属 (*Venturia* spp.)。在另一个实施方式中, 所述病原体选自: 欧文氏菌属 (*Erwinia* spp.), (*Pectobacterium* spp.), 假单胞菌属 (*Pseudomonas* spp.), 萎焉 (*Ralstonia* spp.), 黄单胞菌属 (*Xanthomonas* spp.), 沙门氏菌属 (*Salmonella* spp.), 大肠杆菌属 (*Escherichia* spp.), 李斯特菌属 (*Listeria* spp.), 芽孢杆菌属 (*Bacillus* spp.), 志贺菌属 (*Shigella* spp.), 和葡萄球菌属 (*Staphylococcus* spp.)。在另一个实施方式中, 所述病原体选自: 念珠菌属 (*candida* spp.), 德巴利酵母属 (*Debaryomyces* spp.), 芽孢杆菌属 (*Bacillus* spp.), 弯曲菌属 (*Campylobacter* spp.), 梭状芽孢杆菌属 (*Clostridium* spp.), 隐孢子虫属 (*Cryptosporidium* spp.), 贾第鞭毛虫属 (*Giardia* spp.), 弧菌属 (*Vibrio* spp.), 和 尔森氏菌属 (*Yersinia* spp.)。在另一个实施方式中, 所述方法包括收获前处理或收获后

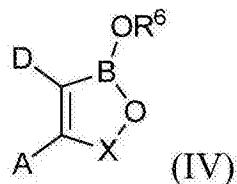
处理。在一个进一步的实施方式中，所述收获前处理选自：种子处理和移植处理。在另一个实施方式中，所述收获后处理选自：现场包装期间的处理；货盘化期间的处理，箱式处理（in-box 处理剂），运输期间的处理，和储存期间和 / 或整个销售网络的处理。

[0026] 在另一个实施方式中，植物或植物部分包含转基因植物或转基因植物部分。在另一个实施方式中，植物或植物部分选自玉米，小麦，棉花，稻，大豆，和低芥酸油菜。在另一个实施方式中，植物或植物部分选自水果，蔬菜，苗圃，草坪，和观赏作物。在一个进一步的实施方式中，所述水果选自：香蕉，菠萝，柑橘属（包括橙，柠檬，酸柠檬，葡萄柚，和其它柑橘），葡萄，西瓜，棱瓜，香瓜，和其它甜瓜，苹果，桃，梨，樱桃，猕猴桃，芒果，油桃，番石榴，番木瓜，柿子，石榴，油梨，无花果，和浆果（包括草莓，越橘，覆盆子，黑莓，穗醋栗，和其它类型的浆果）。在一个进一步的实施方式中，蔬菜选自：番茄，番茄，甘薯，木薯，胡椒，铃状椒，胡萝卜，芹菜，笋瓜，茄子，甘蓝，菜花，绿菜花，芦笋，蘑菇，洋葱，大蒜，扁叶葱，和食荚菜豆（snap bean）。一个进一步的实施方式中，花或花部分选自：玫瑰，康乃馨，兰花，老鹳草属植物，百合或其它观赏花卉。一个进一步的实施方式中，肉类选自牛肉，野牛（bison），小鸡，鹿，山羊，火鸡，猪肉，羊，鱼，水生有壳动物，软体动物或干腌肉制品。

[0027] 在一个实施方式中，所述接触包括通过选自以下的方式施用挥发性抗微生物化合物：喷雾，下雾，热起雾或非热起雾，浸湿，气体处理，及其组合。在一个进一步的实施方式中，所述气体处理选自：从香囊释放，从合成膜或天然膜，纤维材料释放，和 / 或从衬垫或其它包装材料释放，从粉剂释放，从释放气体的发生器释放，使用压缩气瓶或非压缩气瓶释放，从箱内的液滴释放，及其组合。在另一个实施方式中，所述方法进一步包括将所述肉类、植物、植物部分与挥发性植物生长调节剂接触。在一个进一步的实施方式中，挥发性植物生长调节剂为环丙烯化合物。在一个进一步的实施方式中，环丙烯化合物含有 1- 甲基环丙烯（1-MCP）。

[0028] 另一方面，提供使用挥发性抗微生物化合物抵抗影响肉类、植物或植物部分的病原体的方法。所述方法包括将所述肉类、植物或植物部分与有效量的式 (IV) 的挥发性抗微生物化合物及其农用盐接触：

[0029]

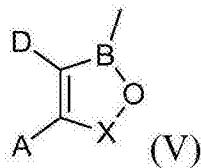


[0030] 其中 A 和 D 与它们所连接的碳原子共同形成 5-、6- 或 7- 元稠环，所述稠环可以通过以下基团取代： $C_1-C_6-$  烷基， $C_1-C_6-$  烷氧基，羟基，卤素，硝基，腈基，氨基，由一个或多个  $C_1-C_6-$  烷基取代的氨基，羧基，酰基，芳氧基，碳酰胺基，由  $C_1-C_6-$  烷基取代的碳酰胺基，磺酰胺基或三氟甲基，或所述稠环可以连接两个氧硼戊环；

[0031] X 为基团  $-CR^7R^8$ ，其中 R<sup>7</sup> 和 R<sup>8</sup> 各自独立地为氢， $C_1-C_6-$  烷基，腈基，硝基，芳基，芳烷基，或 R<sup>7</sup> 和 R<sup>8</sup> 与它们所连接的碳原子共同形成脂环；和

[0032] R<sup>6</sup> 为氢， $C_1-C_{18}-$  烷基，由  $C_1-C_6-$  烷氧基取代的  $C_1-C_{18}-$  烷基， $C_1-C_6-$  烷硫基，羟基，氨基，由  $C_1-C_{18}-$  烷基取代的氨基，羧基，芳基，芳氧基，碳酰胺基，由  $C_1-C_6-$  烷基取代的碳酰胺基，芳基或芳烷基，芳烷基，芳基，杂芳基，环烷基， $C_1-C_{18}-$  亚烷基氨基，由苯基取代的

$C_1-C_{18}-$  亚烷基氨基,  $C_1-C_6-$  烷氧基或  $C_1-C_6-$  烷硫基, 羰基亚烷基氨基或式 (V) 的自由基 :  
[0033]



[0034] 其中 A、D 和 X 为本申请中定义, 不同之处在于 2-(羟甲基) 苯硼酸环状单酯 (boronophthalide)。

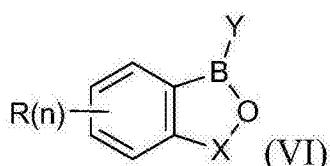
[0035] 在所提供的方法的一个实施方式中, 所述病原体选自 : 链格孢属 (*Alternaria* spp.), 曲霉属 (*Aspergillus* spp.), 葡萄座腔菌属 (*Botryosphaeria* spp.), 葡萄孢属 (*Botrytis* spp.), 丝衣霉属 (*Byssochlamys* spp.), 刺盘孢属 (*Colletotrichum* spp.), 色二孢属 (*Diplodia* spp.), 镰刀菌属 (*Fusarium* spp.), 地菌属 (*Geotrichum* spp.), 毛双孢属 (*Lasiodiplodia* spp.), 链核盘菌属 (*Monilinia* spp.), 毛霉菌属 (*Mucor* spp.), 青霉菌属 (*Penicillium* spp.), 无柄盘菌属 (*Pezicula* spp.), 拟茎点霉属 (*Phomopsis* spp.), 疫病菌属 (*Phytophthora* spp.), 腐霉属 (*Pythium* spp.), 丝核菌属 (*Rhizoctonia* spp.), 根霉属 (*Rhizopus* spp.), 核盘菌属 (*Sclerotinia* spp.), 和 黑星病菌属 (*Venturia* spp.)。在另一个实施方式中, 所述病原体选自 : 欧文氏菌属 (*Erwinia* spp.), (*Pectobacterium* spp.), 假单胞菌属 (*Pseudomonas* spp.), 萎焉 (*Ralstonia* spp.), 黄单胞菌属 (*Xanthomonas* spp.) ; 沙门氏菌属 (*Salmonella* spp.), 大肠杆菌属 (*Escherichia* spp.), 李斯特菌属 (*Listeria* spp.), 芽孢杆菌属 (*Bacillus* spp.), 志贺菌属 (*Shigella* spp.), 和葡萄球菌属 (*Staphylococcus* spp.)。在另一个实施方式中, 所述病原体选自 : 念珠菌属 (*candida* spp.), 德巴利酵母属 (*Debaryomyces* spp.), 芽孢杆菌属 (*Bacillus* spp.), 弯曲菌属 (*Campylobacter* spp.), 梭状芽孢杆菌属 (*Clostridium* spp.), 隐孢子虫属 (*Cryptosporidium* spp.), 贾第鞭毛虫属 (*Giardia* spp.), 弧菌属 (*Vibrio* spp.), 和尔森氏菌属 (*Yersinia* spp.)。在另一个实施方式中, 所述方法包括收获前处理或收获后处理。在一个进一步的实施方式中, 所述收获前处理选自 : 种子处理和移植处理。在另一个实施方式中, 所述收获后处理选自 : 现场包装期间的处理 ; 货盘化期间的处理, 箱式处理, 运输期间的处理, 和储存期间的处理和 / 或整个销售网络。

[0036] 在另一个实施方式中, 植物或植物部分包含转基因植物或转基因植物部分。在另一个实施方式中, 植物或植物部分选自玉米, 小麦, 棉花, 稻, 大豆, 和低芥酸油菜。在另一个实施方式中, 植物或植物部分选自水果, 蔬菜, 苗圃, 草坪, 和观赏作物。在一个进一步的实施方式中, 所述水果选自 : 香蕉, 菠萝, 柑橘属 (包括橙, 柠檬, 酸柠檬, 葡萄柚, 和其它柑橘), 葡萄, 西瓜, 棱瓜, 香瓜, 和其它甜瓜, 苹果, 桃, 梨, 樱桃, 猕猴桃, 芒果, 油桃, 番石榴, 番木瓜, 柿子, 石榴, 油梨, 无花果, 和浆果 (包括草莓, 越橘, 覆盆子, 黑莓, 穗醋栗, 和其它类型的浆果)。在一个进一步的实施方式中, 蔬菜选自 : 番茄, 番茄, 甘薯, 木薯, 胡椒, 铃状椒, 胡萝卜, 芹菜, 笋瓜, 茄子, 甘蓝, 菜花, 绿菜花, 芦笋, 蘑菇, 洋葱, 大蒜, 扁叶葱, 和食荚菜豆。一个进一步的实施方式中, 花或花部分选自 : 玫瑰, 康乃馨, 兰花, 老鹳草属植物, 百合或其它观赏花卉。一个进一步的实施方式, 肉类选自牛肉, 野牛, 小鸡, 鹿, 山羊, 火鸡, 猪肉, 羊, 鱼, 水生有壳动物, 软体动物, 或干腌肉制品。

[0037] 在一个实施方式中,所述接触包括通过选自以下的方式施用挥发性抗微生物化合物:喷雾,下雾,热起雾或非热起雾,浸湿,气体处理,及其组合。在一个进一步的实施方式中,所述气体处理选自:从香囊释放,从合成膜或天然膜,纤维材料释放,和/或从衬垫或其它包装材料释放,从粉剂释放,从释放气体的发生器释放,使用压缩气瓶或非压缩气瓶释放,从箱内的液滴释放,及其组合。在另一个实施方式中,所述方法进一步包括将所述肉类、植物或植物部分与挥发性植物生长调节剂接触。在一个进一步的实施方式中,挥发性植物生长调节剂为环丙烯化合物。在一个进一步的实施方式中,环丙烯化合物含有1-甲基环丙烯(1-MCP)。

[0038] 另一方面,提供使用挥发性抗微生物化合物抵抗影响肉类、植物或植物部分的病原体的方法。所述方法包括将所述肉类、植物或植物部分与有效量的式(VI)的挥发性抗微生物化合物及其农用盐接触:

[0039]



[0040] 其中每个R独立地为氢,烷基,烯,炔,卤代烷基,卤代烯基,卤代炔基,烷氧基,烯氧基,卤代烷氧基,芳基,杂芳基,芳烷基,芳基烯基,芳基炔基,杂芳烷基,杂芳基烯基,杂芳基炔基,卤素,羟基,腈基,胺,酯,羧酸,酮,醇,硫醚,亚砜,砜,磺基肟,硫亚胺,磺酰胺,硫酸酯,磺酸酯,硝基烷基,酰胺,肟,亚胺,羟基胺,肼,腙,氨基甲酸酯,硫代氨基甲酸酯,脲,硫脲,碳酸酯,芳氧基,或杂芳基氧基;

[0041] n = 1, 2, 3, 或 4;

[0042] B 为硼;

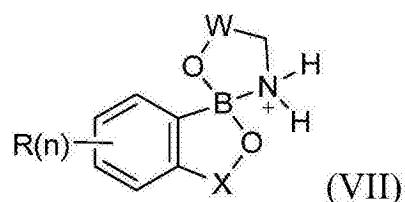
[0043] X = (CR<sub>2</sub>)<sub>m</sub>, 其中 m = 1, 2, 3, 或 4;

[0044] Y 为烷基,烯,炔,卤代烷基,卤代烯基,卤代炔基,烷氧基,烯氧基,卤代烷氧基,芳基,杂芳基,芳烷基,芳基烯基,芳基炔基,杂芳烷基,杂芳基烯基,杂芳基炔基,羟基,腈基,胺,酯,羧酸,酮,醇,硫醚,亚砜,砜,磺基肟,硫亚胺,磺酰胺,硫酸酯,磺酸酯,硝基烷基,酰胺,肟,亚胺,羟基胺,肼,腙,氨基甲酸酯,硫代氨基甲酸酯,脲,硫脲,碳酸酯,芳氧基,或杂芳基氧基;

[0045] 条件是当Y为羟基时,R不是芳氧基,或杂芳基氧基。

[0046] 在一个实施方式中,挥发性抗微生物化合物具有式(VII)的结构:

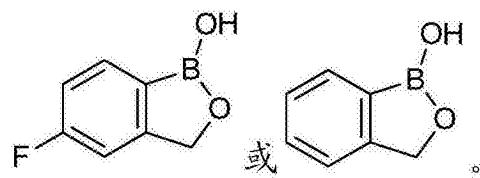
[0047]



[0048] 其中W = (CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>,其中q为1,2,或3。

[0049] 在另一个实施方式中,挥发性抗微生物化合物具有以下结构:

[0050]



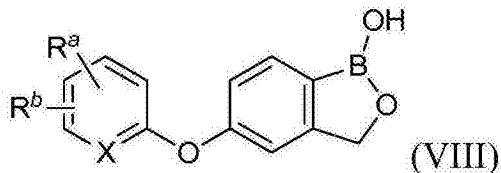
[0051] 在所提供的方法的一个实施方式中,所述病原体选自:链格孢属 (*Alternaria* spp.), 曲霉属 (*Aspergillus* spp.), 葡萄座腔菌属 (*Botryosphaeria* spp.), 葡萄孢属 (*Botrytis* spp.), 丝衣霉属 (*Byssochlamys* spp.), 刺盘孢属 (*Colletotrichum* spp.), 色二孢属 (*Diplodia* spp.), 镰刀菌属 (*Fusarium* spp.), 地菌属 (*Geotrichum* spp.), 毛双孢属 (*Lasiodiplodia* spp.), 链核盘菌属 (*Monilinia* spp.), 毛霉菌属 (*Mucor* spp.), 青霉菌属 (*Penicillium* spp.), 无柄盘菌属 (*Pezicula* spp.), 拟茎点霉属 (*Phomopsis* spp.), 疫病菌属 (*Phytophthora* spp.), 腐霉属 (*Pythium* spp.), 丝核菌属 (*Rhizoctonia* spp.), 根霉属 (*Rhizopus* spp.), 核盘菌属 (*Sclerotinia* spp.), 和黑星病菌属 (*Venturia* spp.)。在另一个实施方式中,所述病原体选自:欧文氏菌属 (*Erwinia* spp.), (*Pectobacterium* spp.), 假单胞菌属 (*Pseudomonas* spp.), 萎焉 (*Ralstonia* spp.), 黄单胞菌属 (*Xanthomonas* spp.), 沙门氏菌属 (*Salmonella* spp.), 大肠杆菌属 (*Escherichia* spp.), 李斯特菌属 (*Listeria* spp.), 芽孢杆菌属 (*Bacillus* spp.), 志贺菌属 (*Shigella* spp.), 和葡萄球菌属 (*Staphylococcus* spp.)。在另一个实施方式中,所述方法包括收获前处理或收获后处理。在一个进一步的实施方式中,所述收获前处理选自:种子处理和移植处理。在另一个实施方式中,所述收获后处理选自:现场包装期间的处理;货盘化期间的处理,箱式处理,运输期间的处理,和储存期间的处理和/或整个销售网络。

[0052] 在另一个实施方式中,植物或植物部分包含转基因植物或转基因植物部分。在另一个实施方式中,植物或植物部分选自玉米,小麦,棉花,稻,大豆,和低芥酸油菜。在另一个实施方式中,植物或植物部分选自水果,蔬菜,苗圃,草坪,和观赏作物。在一个进一步的实施方式中,所述水果选自:香蕉,菠萝,柑橘属(包括橙,柠檬,酸柠檬,葡萄柚,和其它柑橘),葡萄,西瓜,棱瓜,香瓜,和其它甜瓜,苹果,桃,梨,樱桃,猕猴桃,芒果,油桃,番石榴,番木瓜,柿子,石榴,油梨,无花果,和浆果(包括草莓,越橘,覆盆子,黑莓,穗醋栗,和其它类型的浆果)。在一个进一步的实施方式中,蔬菜选自:番茄,番茄,甘薯,木薯,胡椒,铃状椒,胡萝卜,芹菜,笋瓜,茄子,甘蓝,菜花,绿菜花,芦笋,蘑菇,洋葱,大蒜,扁叶葱,和食荚菜豆。一个进一步的实施方式中,花或花部分选自:玫瑰,康乃馨,兰花,老鹳草属植物,百合或其它观赏花卉。一个进一步的实施方式,肉类选自牛肉,野牛,小鸡,鹿,山羊,火鸡,猪肉,羊,鱼,水生有壳动物,软体动物,或干腌肉制品。

[0053] 在一个实施方式中,所述接触包括通过选自以下的方式施用挥发性抗微生物化合物:喷雾,下雾,热起雾或非热起雾,浸湿,气体处理,及其组合。在一个进一步的实施方式中,所述气体处理选自:从香囊释放,从合成膜或天然膜,纤维材料释放,和/或从衬垫或其它包装材料释放,从粉剂释放,从释放气体的发生器释放,使用压缩气瓶或非压缩气瓶释放,从箱内的液滴释放,及其组合。在另一个实施方式中,所述方法进一步包括将所述肉类、植物、植物部分与挥发性植物生长调节剂接触。在一个进一步的实施方式中,挥发性植物生长调节剂为环丙烯化合物。在一个进一步的实施方式中,环丙烯化合物含有1-甲基环丙烯(1-MCP)。

[0054] 另一方面, 提供使用挥发性抗微生物化合物抵抗影响肉类、植物或植物部分的病原体的方法。所述方法包括将所述肉类、植物或植物部分与有效量的式 (VIII) 的挥发性抗微生物化合物及其农用盐接触:

[0055]



[0056] 其中  $R^a$  为  $CN$ ,  $C(O)NR^9R^{10}$ , 或  $C(O)OR^{11}$ , 其中  $R^{11}$  为氢, 取代烷基, 或未取代烷基,

[0057]  $X$  为  $N$ ,  $CH$  和  $CR^b$ ;

[0058]  $R^b$  为卤素, 取代或未取代烷基,  $C(O)R^{12}$ ,  $C(O)OR^{12}$ ,  $OR^{12}$ ,  $NR^{12}R^{13}$ , 其中  $R^9$ ,  $R^{10}$ ,  $R^{12}$ , 和  $R^{13}$  独立地为氢, 取代或未取代烷基, 取代或未取代杂烷基, 取代或未取代环烷基, 取代或未取代杂环烷基, 取代或未取代芳基, 或取代或未取代杂芳基;

[0059] 条件是  $R^9$  和  $R^{10}$ , 与它们所连接的碳, 任选地组合形成 4- 至 8- 元取代或未取代杂环烷基环;

[0060] 并且条件是  $R^{12}$  和  $R^{13}$ , 与它们所连接的碳, 任选地组合形成 4- 至 8- 元取代或未取代杂环烷基环。

[0061] 在所提供的方法的一个实施方式中, 所述病原体选自: 链格孢属 (*Alternaria* spp.), 曲霉属 (*Aspergillus* spp.), 葡萄座腔菌属 (*Botryosphaeria* spp.), 葡萄孢属 (*Botrytis* spp.), 丝衣霉属 (*Byssochlamys* spp.), 刺盘孢属 (*Colletotrichum* spp.), 色二孢属 (*Diplodia* spp.), 镰刀菌属 (*Fusarium* spp.), 地菌属 (*Geotrichum* spp.), 毛双孢属 (*Lasiodiplodia* spp.), 链核盘菌属 (*Monilinia* spp.), 毛霉菌属 (*Mucor* spp.), 青霉菌属 (*Penicillium* spp.), 无柄盘菌属 (*Pezicula* spp.), 拟茎点霉属 (*Phomopsis* spp.), 疫病菌属 (*Phytophthora* spp.), 腐霉属 (*Pythium* spp.), 丝核菌属 (*Rhizoctonia* spp.), 根霉属 (*Rhizopus* spp.), 核盘菌属 (*Sclerotinia* spp.), 和 黑星病菌属 (*Venturia* spp.)。在另一个实施方式中, 所述病原体选自: 欧文氏菌属 (*Erwinia* spp.), (*Pectobacterium* spp.), 假单胞菌属 (*Pseudomonas* spp.), 萎焉 (*Ralstonia* spp.), 黄单胞菌属 (*Xanthomonas* spp.), 沙门氏菌属 (*Salmonella* spp.), 大肠杆菌属 (*Escherichia* spp.), 李斯特菌属 (*Listeria* spp.), 芽孢杆菌属 (*Bacillus* spp.), 志贺菌属 (*Shigella* spp.), 和葡萄球菌属 (*Staphylococcus* spp.)。在另一个实施方式中, 所述病原体选自: 念珠菌属 (*candida* spp.), 德巴利酵母属 (*Debaryomyces* spp.), 芽孢杆菌属 (*Bacillus* spp.), 弯曲菌属 (*Campylobacter* spp.), 梭状芽孢杆菌属 (*Clostridium* spp.), 隐孢子虫属 (*Cryptosporidium* spp.), 贾第鞭毛虫属 (*Giardia* spp.), 弧菌属 (*Vibrio* spp.), 和尔森氏菌属 (*Yersinia* spp.)。在另一个实施方式中, 所述方法包括收获前处理或收获后处理。在一个进一步的实施方式中, 所述收获前处理选自: 种子处理和移植处理。在另一个实施方式中, 所述收获后处理选自: 现场包装期间的处理; 货盘化期间的处理, 箱式处理, 运输期间的处理, 和储存期间的处理和 / 或整个销售网络。

[0062] 在另一个实施方式中, 植物或植物部分包含转基因植物或转基因植物部分。在另一个实施方式中, 植物或植物部分选自玉米, 小麦, 棉花, 稻, 大豆, 和低芥酸油菜。在另一

个实施方式中，植物或植物部分选自水果，蔬菜，苗圃，草坪，和观赏作物。在一个进一步的实施方式中，所述水果选自：香蕉，菠萝，柑橘属（包括橙，柠檬，酸柠檬，葡萄柚，和其它柑橘），葡萄，西瓜，棱瓜，香瓜，和其它甜瓜，苹果，桃，梨，樱桃，猕猴桃，芒果，油桃，番石榴，番木瓜，柿子，石榴，油梨，无花果，和浆果（包括草莓，越橘，覆盆子，黑莓，穗醋栗，和其它类型的浆果）。在一个进一步的实施方式中，蔬菜选自：番茄，番茄，甘薯，木薯，胡椒，铃状椒，胡萝卜，芹菜，笋瓜，茄子，甘蓝，菜花，绿菜花，芦笋，蘑菇，洋葱，大蒜，扁叶葱，和食荚菜豆。一个进一步的实施方式中，花或花部分选自：玫瑰，康乃馨，兰花，老鹳草属植物，百合或其它观赏花卉。一个进一步的实施方式，肉类选自牛肉，野牛，小鸡，鹿，山羊，火鸡，猪肉，羊，鱼，水生有壳动物，软体动物，或干腌肉制品。

[0063] 在一个实施方式中，所述接触包括通过选自以下的方式施用挥发性抗微生物化合物：喷雾，下雾，热起雾或非热起雾，浸湿，气体处理，及其组合。在一个进一步的实施方式中，所述气体处理选自：从香囊释放，从合成膜或天然膜释放，从衬垫或其它包装材料释放，从粉剂释放，从释放气体的发生器释放，使用压缩气瓶或非压缩气瓶释放，从箱内的液滴释放，及其组合。在另一个实施方式中，所述方法进一步包括将所述肉类、植物、植物部分与挥发性植物生长调节剂接触。在一个进一步的实施方式中，挥发性植物生长调节剂为环丙烯化合物。在一个进一步的实施方式中，环丙烯化合物含有 1- 甲基环丙烯 (1-MCP)。

## 附图说明

[0064] 图 1 显示本发明的示例性化合物 A 的化学结构。

[0065] 图 2 显示本发明的示例性化合物 B 的化学结构。

[0066] 图 3 显示实施例 2 中试验的十四种化合物。

[0067] 图 4 显示使用化合物 A 的示例性体内抑制结果的代表性像片，其中 0.04mg 的化合物 A 显示 100% 抑制和 0.0024mg 的化合物 A 显示不抑制。

[0068] 图 5 显示通过在 21°C 的 3- 天处理，随后在 21°C 另外 2 天之后化合物 A 的挥发施用，示例性体内抑制灰葡萄孢菌 (*Botrytis cinerea*) 的代表性像片。

## 具体实施方式

[0069] 除非另外指明，否则本申请（包括说明书和权利要求书）中所用的以下术语具有下面给出的定义。必须注意，如说明书和所附权利要求中所用，除非上下文中另外明确指明，否则单数形式包括复数指代物。标准化学术语的定义可以在以下参考著作中得到：包括 Carey 和 Sundberg, Advanced Organic Chemistry 第四版, Vols. A (2000) 和 B (2001), Plenum Press, New York, N. Y.。

[0070] 本申请中所用的短语“基团”是指一个分子的具体片段或官能团。化学基团经常为嵌入分子内或悬垂于分子的认可的化学实体。

[0071] 本申请中所用的短语“杂原子”和“杂 -”是指除碳 (C) 和氢 (H) 以外的原子。杂原子的实例包括氧 (O)，氮 (N)，硫 (S)，硅 (Si)，锗 (Ge)，铝 (Al)，和硼 (B)。

[0072] 本申请中所用的短语“卤代”和“卤素”可互换，是指氟 (-F)，氯 (-Cl)，溴 (-Br)，和碘 (-I)。

[0073] 本申请中所用的短语“烷基”是指未取代的或取代的烃基，并且可包括线性，支化，

环状,饱和和 / 或不饱和特征。尽管烷基可以为“不饱和烷基”基团,这意味着它包含至少一个烯基或炔基基团,但典型地,烷基为“饱和烷基”基团,这意味着它不包含任何烯基或炔基基团。同样,尽管烷基可以为环状,但烷基典型地为环状基团。因此,在一些实施方式中,“烷基”是指在一些实施方式中,具有约一个至约三十个碳原子的任选取代的直链或任选取代的支链饱和烃单价基团,在一些实施方式中,为约一个至约十五个碳原子,和在进一步的实施方式中,为约一个至约六个碳原子。饱和烷基自由基的实例包括但不限于,甲基,乙基,正丙基,异丙基,2-甲基-1-丙基,2-甲基-2-丙基,2-甲基-1-丁基,3-甲基-1-丁基,2-甲基-3-丁基,2,2-二甲基-1-丙基,2-甲基-1-戊基,3-甲基-1-戊基,4-甲基-1-戊基,2-甲基-2-戊基,3-甲基-2-戊基,4-甲基-2-戊基,2,2-二甲基-1-丁基,3,3-二甲基-1-丁基,2-乙基-1-丁基,丁基,异丁基,仲丁基,叔丁基,正戊基,异戊基,新戊基,和正己基,和较长烷基,如庚基和辛基。应当注意,当它出现在本申请中时,数字范围如“1至6”是指给定范围内的每一个整数;例如,“1至6个碳原子”或“C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>”或“C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>”意味着烷基可以包括1个碳原子,2个碳原子,3个碳原子,4个碳原子,5个碳原子,和 / 或6个碳原子,但是本定义还覆盖存在其中未指定数字范围的术语“烷基”的情形。

[0074] 本申请中所用的短语“取代烷基”是指本申请中定义的烷基,其中一个或多个(至多约五个,优选至多约三个)氢原子被独立选自本申请中定义的取代基团的取代基取代。

[0075] 本申请中所用的短语“取代基”和“取代的”是指可以用于取代分子上另一个基团的基团。这种基团为化学领域中的技术人员已知,并且可以包括但不限于,一个或多个的以下独立选择的基团或其指定的子集:卤素,-CN,-OH,-NO<sub>2</sub>,-N<sub>3</sub>,=O,=S,=NH,-SO<sub>2</sub>,-NH<sub>2</sub>,-COOH,硝基烷基,氨基,包括单取代和二取代的氨基,氰酰,异氰酰,硫代氰酰,异硫代氰酰,胍基(guanidinyl),O-氨基甲酰,N-氨基甲酰,硫代氨基甲酰,脲基,异脲基,硫脲基,异硫脲基,巯基,磺酰基(sulfanyl),亚磺酰基,磺酰基(sulfonyl),磺酰胺基(sulfonamidyl),磷酰基(phosphonyl),磷脂酰基,磷酰胺基(phosphoramidyl),二烷基氨基,二芳基氨基,二芳烷基氨基;及其所保护的化合物。本领域技术人员已知可以形成以上取代基的受保护化合物的保护基团,其可以在例如以下参考文献中得到:Greene 和 Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, 第三版; John Wiley& Sons, New York, N. Y. (1999), 和 Kocienski, Protective Groups; Thieme Verlag, New York, N. Y. (1994), 将其全部内容并入本申请中,以作参考。

[0076] 本申请中所用的短语“烷氧基”是指基团-O-烷基,其中烷基为本申请中所定义。在一个实施方式中,烷氧基包括,例如,甲氧基,乙氧基,正丙氧基,异丙氧基,正丁氧基,叔丁氧基,仲丁氧基,正戊氧基,正己氧基,和1,2-二甲基丁氧基等。烷氧基可为未取代的或取代的。

[0077] 本申请中所用的短语“环状”和“几元环”是指任何环状结构,包括脂环,杂环,芳族,杂芳族,和多环稠合或非稠合环体系,如本申请中所述。术语“几元”意味着至表示构成环的骨架原子数。因此,例如,吡啶,吡喃,和嘧啶为六元环;吡咯,四氢呋喃,和噻吩为五元环。

[0078] 本申请中所用的短语“芳族”是指具有共轭不饱和(4n+2)π电子体系(其中n为正整数)(有时称作离域π电子体系)的环状或多环状基团。

[0079] 本申请中所用的短语“芳基”是指任选取代的,芳族环状,烃单价基团,其有六个至

约十二个环原子，优选六个至约十个碳原子，包括稠合 (fused) (或稠合 (condensed)) 和非稠合芳族环。稠合芳族环自由基包含两个至四个稠合环，其中连接的环为芳族环，并且稠合环内的其它单个环可以为环烷基，环烯基，环炔基，杂环烷基，杂环烯基，杂环炔基，芳族，杂芳族，或其任何组合。单个环芳基的非限定性实施例包括苯基；稠合环芳基，包括萘基，蒽基，薁基；和非稠合二芳基，包括联苯基。

[0080] 本申请中所用的短语“取代芳基”是指芳基，如本申请中所定义，其中一个或多个（至多约五个，优选至多约三个）氢原子通过取代基取代，所述取代基独立选自本申请中定义的基团（除另外芳基取代基的定义限制的基团以外）。

[0081] 本申请中所用的短语“杂芳基”是指任选取代的，芳族环状单价基团，包含约五个至约十二个骨架环原子，优选五个至约十个环原子，并且包括稠合 (fused) (或稠合 (condensed)) 和非稠合芳族环，并且具有一个或多个（一个至十个，优选约一个至约四个）环原子，所述环原子选自除碳（即，杂原子）以外的原子，例如氧，氮，硫，硒，磷或其组合。术语杂芳基包括任选取代的稠合和非稠合杂芳基自由基，其具有至少一个杂原子。稠合杂芳基自由基可以包含两个至四个稠合环，其中连接的环为杂芳族环，并且稠合环体系内的其它单个环可以为脂环，杂环，芳族，杂芳族，或其任何组合。术语杂芳基还包括具有五个至约十二个骨架环原子的稠合和非稠合杂芳基，以及具有五个至约十个骨架环原子的那些。杂芳基的实例包括但不限于，吖啶基，苯并 [1, 3] 二氧杂环戊二烯，苯并咪唑基，苯并吲哚基，苯并异噁唑基，benzokisazolyl，苯并呋喃基，苯并呋咱基 (furazanyl)，苯并吡喃基，苯并噻二唑基，苯并噻唑基，苯并 [b] 噻吩基，苯并苯硫基，苯并噻喃基，苯并三唑基，苯并噁唑基，咔唑基，咔啉基，苯并吡喃基 (chromenyl)，噌啉基 (cinnolinyl)，呋喃基，呋咱基 (furazanyl)，呋喃并吡啶基 (furopyridinyl)，呋喃基，咪唑基，吲唑基，吲哚基，吲哚烷基 (indolidinyl)，吲嗪基 (indolizinyl)，异苯并呋喃基，异吲哚基，异噁唑基，异噁啉基，异噻唑基，氢化萘基 (naphthylidinyl)，萘啶基 (naphthyridinyl)，噁二唑基，噁唑基，吩噁嗪基 (phenoxyazinyl)，吩噻嗪基 (phenothiazinyl)，吩嗪基 (phenazinyl)，phenoxythiophenyl，噻蒽基 (thianthrenyl)，菲啶基，邻二氮杂菲基 (phenathrolinyl)，2, 3-二氮杂萘基 (phthalazinyl)，蝶啶基 (pteridinyl)，嘌呤基 (purinyl)，puteridinyl，吡唑基 (pyrazyl)，吡唑基 (pyrazolyl)，吡啶基 (pyridyl)，吡啶基 (pyridinyl)，哒嗪基 (pyridazinyl)，吡嗪基，嘧啶基 (pyrimidinyl)，嘧啶基 (pyrimidyl)，吡咯基，喹唑啉基，喹啉基 (quinolinyl)，喹喔啉基，四唑基，噻二唑基，噻唑基，噻吩基，三嗪基，和 (1, 2, 3, )- 和 (1, 2, 4)- 三唑基等，及其适当时的氧化物，例如吡啶基 -N- 氧化物。

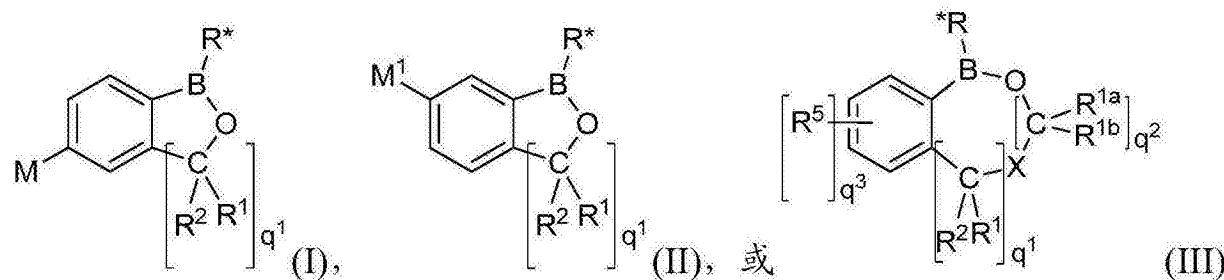
[0082] 本申请中所用的短语“取代杂芳基”是指杂芳基，如本申请中所定义，其中一个或多个（至多约五个，优选至多约三个）氢原子通过取代基取代，所述取代基独立选自本申请中定义的基团。

[0083] 本申请中所用的短语“离去基团”是指具有与其在合成有机化学中常规相关联的含义的基团，即，在取代反应条件下可取代的原子或基团。的离去基团的实例包括但不限于，卤素、烷烃 - 或亚芳基磺酰氧基，如甲烷磺酰氧基，乙烷磺酰氧基，硫代甲基，苯磺酰基，氨基，甲苯磺酰氧基，和噻吩氧基，二卤代膦酰氧基 (dihalophosphinoyloxy)，任选取代的苄氧基，异丙氧基，和酰氧基等。在一些实施方式中，离去基团可为 HC(0)-COOH 或 RC(0)-COOH，其中 R 为 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基或取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基。

[0084] 本申请中所述的本发明化合物可以使用本领域技术人员已知的标准合成技术或使用本领域中已知的方法与本申请中所述的方法的组合来合成。用于合成本申请中所述本发明化合物的原料可得自商业来源,如 Aldrich Chemical Co. (Milwaukee, Wis.), Sigma Chemical Co. (St. Louis, Mo.), 或可合成原料。本申请所述的化合物,和具有不同取代基的其它相关化合物可使用本领域技术人员已知的技术和材料合成,例如以下中所述:March, Advanced Organic Chemistry 第四版 (1992) John Wiley&Sons, New York, N. Y. ;Carey 和 Sundberg, Advanced Organic Chemistry 第四版, Vols. A(2000) 和 B(2001) Plenum Press, New York, N. Y., 以及 Greene 和 Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, 第三版 (1999) John Wiley&Sons, New York, N. Y. (将其全部内容并入以作参考)。用于制备本申请中所述化合物的通常方法可以源自本领域中的已知反应,并且所述反应可以通过使用适当的试剂和条件修改,正如本领域技术人员会认识到的,用于引入本申请中提供的式中得到的各种基团。例如,本申请所述的化合物可使用各种亲电子试剂或亲核试剂修改以形成新的官能团或取代基。

[0085] 在一些实施方式中,本发明的挥发性抗微生物化合物具有式 (I), (II) 或 (III) 的结构及其农用盐:

[0086]



[0087] 其中  $q_1$  和  $q_2$  独立地为 1, 2, 或 3;

[0088]  $q_3 = 0, 1, 2, 3,$  或 4;

[0089]  $M$  为氢, 卤素,  $-OCH_3$ , 或  $-CH_2-O-CH_2-O-CH_3$ ;

[0090]  $M^1$  为卤素,  $-CH_2OH$ , 或  $-OCH_3$ ;

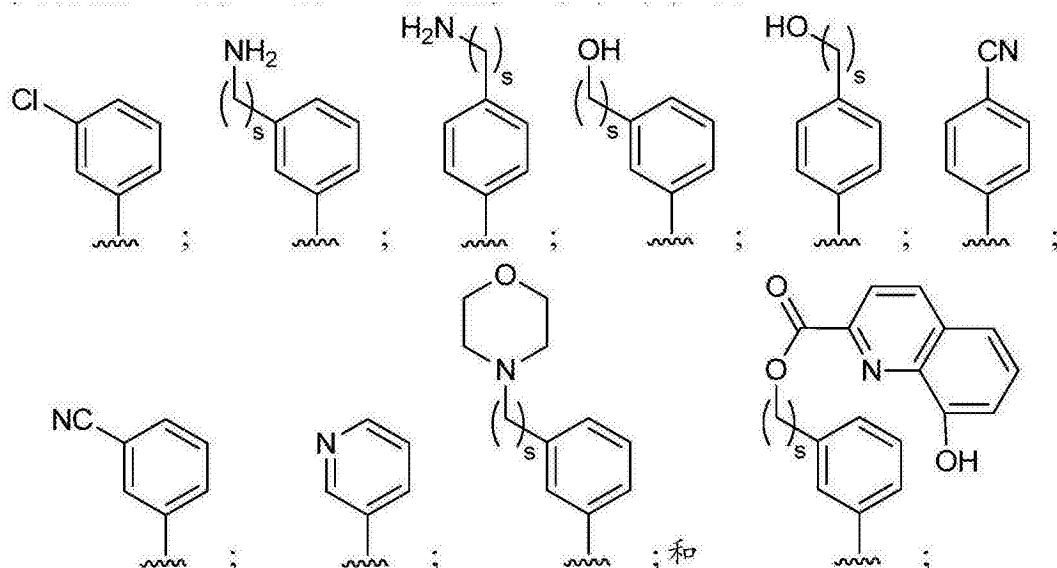
[0091]  $X$  为 O, S, 或  $NR^{1c}$ , 其中  $R^{1c}$  为氢, 取代烷基, 或未取代烷基;

[0092]  $R^1, R^{1a}, R^{1b}, R^2$  和  $R^5$  独立地为氢, OH,  $NH_2$ , SH, CN,  $NO_2$ ,  $SO_2$ ,  $OSO_2OH$ ,  $OSO_2NH_2$ , 取代或未取代环烷基, 取代或未取代杂环烷基, 取代或未取代芳基, 或取代或未取代杂芳基;

[0093]  $R^*$  为取代或未取代芳基, 取代或未取代芳烷基, 取代或未取代杂芳基, 取代或未取代杂芳烷基, 或取代或未取代乙烯基;

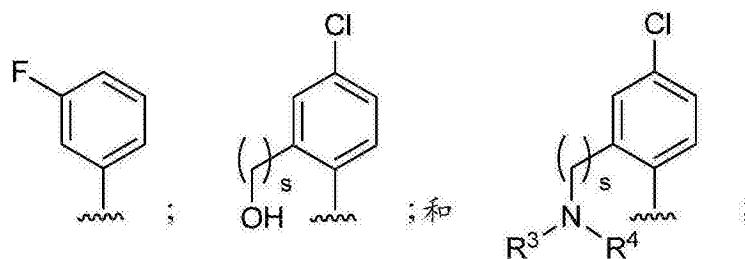
[0094] 条件是当  $M$  为 F 时,  $R^*$  不选自以下中的单元:

[0095]



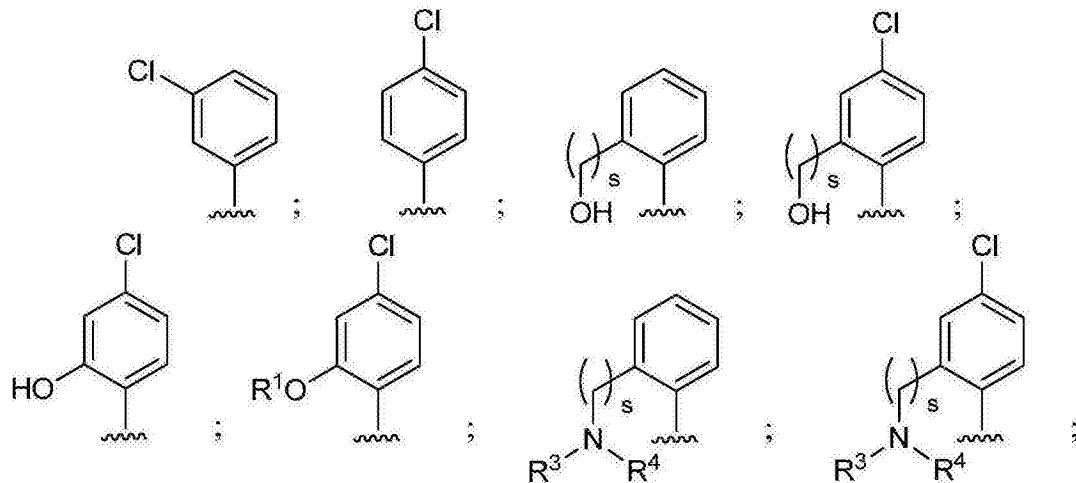
[0096] 并且条件是当 M 为 Cl 时, R\* 不选自以下中的单元 :

[0097]

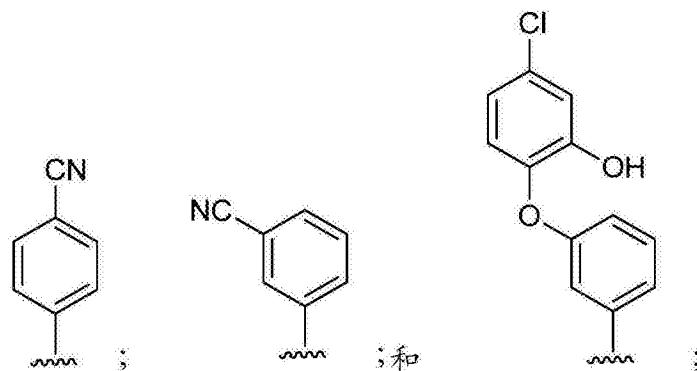


[0098] 并且条件是当 M 为 氢 时, R\* 不选自以下中的单元 :

[0099]



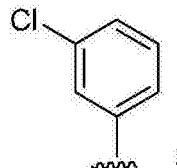
[0100]



[0101] 其中  $s = 1$  或  $2$ ;  $R^3$  和  $R^4$  独立地为甲基或乙基;

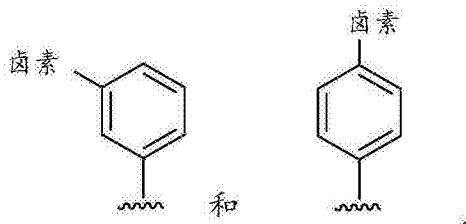
[0102] 并且条件是当  $M$  为  $OCH_3$  时,  $R^*$  不选自以下中的单元:

[0103]



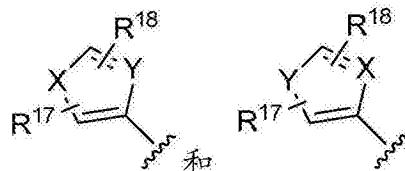
[0104] 并且条件是当  $M^1$  为  $F$  时,  $R^*$  不选自以下中的单元:

[0105]



[0106] 在一个实施方式中,  $R^*$  具有选自以下的结构:

[0107]



[0108] 其中  $X$  为选自以下的单元:  $CH = CH$ ,  $N = CH$ ,  $NR^{14}$ ,  $O$  和  $S$ ;

[0109] 其中  $R^{14}$  为选自以下的单元:  $H$ , 取代或未取代烷基, 取代或未取代芳基和取代或未取代芳烷基;

[0110]  $Y$  为选自以下的单元:  $CH$  和  $N$ ;

[0111]  $R^{17}$  和  $R^{18}$  为独立选自以下的单元:  $H$ , 取代或未取代烷基, 取代或未取代芳基, 取代或未取代芳烷基,  $(CH_2)_vOH$ ,  $(CH_2)_wNR^{15}R^{16}$ ,  $CO_2H$ ,  $CO_2-$  烷基,  $CONH_2$ ,  $S-$  烷基,  $S-$  芳基,  $SO-$  烷基,  $SO-$  芳基,  $SO_2-$  烷基,  $SO_2-$  芳基,  $SO_2H$ ,  $SCF_2$ ,  $CN$ , 卤素,  $CF_3$  和  $NO_2$ ;

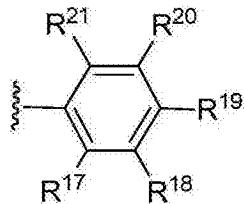
[0112] 其中  $R^{15}$  和  $R^{16}$  为独立选自以下的单元: 氢, 取代或未取代烷基和取代或未取代烷酰基;

[0113]  $v = 1, 2$ , 或  $3$ ; 和

[0114]  $w = 0, 1, 2$ , 或  $3$ .

[0115] 在另一个实施方式中, R\* 具有以下结构 :

[0116]



[0117] 其中 R<sup>17</sup>, R<sup>18</sup>, R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, 和 R<sup>21</sup> 独立地选自以下 :H, 取代或未取代烷基, 取代或未取代芳基, 取代或未取代芳烷基, 取代或未取代烷基氧基, 取代或未取代芳基氧基, 取代或未取代噁唑烷 -2- 基, (CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>OH, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>- 烷基, CONH<sub>2</sub>, CONH- 烷基, CON( 烷基 )<sub>2</sub>, OH, SH, S- 烷基, S- 芳基, SO- 烷基, SO- 芳基, SO<sub>2</sub>- 烷基, SO<sub>2</sub>- 芳基, SO<sub>2</sub>H, SCF<sub>3</sub>, CN, 卤素, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>u</sub>NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>, SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH- 烷基和 OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>N( 烷基 )<sub>2</sub>;

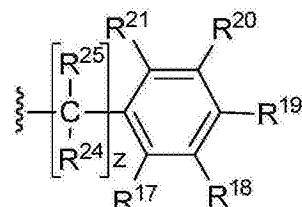
[0118] 其中 t = 1, 2, 或 3 ;

[0119] u = 0, 1 或 2 ;

[0120] R<sup>22</sup> 和 R<sup>23</sup> 独立地选自以下 :H, 取代或未取代烷基, 和取代或未取代烷酰基。

[0121] 在另一个实施方式中, R\* 具有以下结构 :

[0122]



[0123] 其中 R<sup>17</sup>, R<sup>18</sup>, R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, 和 R<sup>21</sup> 独立地选自以下 :H, 取代或未取代烷基, 取代或未取代芳基, 取代或未取代芳烷基, 取代或未取代烷基氧基, 取代或未取代芳基氧基, 取代或未取代噁唑烷 -2- 基, (CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>OH, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>- 烷基, CONH<sub>2</sub>, CONH- 烷基, CON( 烷基 )<sub>2</sub>, OH, SH, S- 烷基, S- 芳基, SO- 烷基, SO- 芳基, SO<sub>2</sub>- 烷基, SO<sub>2</sub>- 芳基, SO<sub>2</sub>H, SCF<sub>3</sub>, CN, 卤素, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>u</sub>NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>, SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH- 烷基和 OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>N( 烷基 )<sub>2</sub>;

[0124] 其中 t = 1, 2, 或 3 ;

[0125] u = 0, 1 或 2 ;

[0126] R<sup>22</sup> 和 R<sup>23</sup> 独立地选自以下 :H, 取代或未取代烷基, 和取代或未取代烷酰基 ;

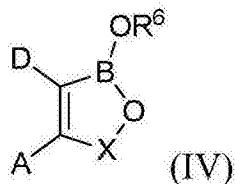
[0127] R<sup>24</sup> 和 R<sup>25</sup> 独立地选自以下 :H, 取代或未取代烷基, 取代或未取代芳基, 取代或未取代芳烷基, 取代或未取代烷基氧基, 取代或未取代芳基氧基, 取代或未取代噁唑烷 -2- 基, (CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>OH, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>- 烷基, CONH<sub>2</sub>, CONH- 烷基, CON( 烷基 )<sub>2</sub>, OH, SH, S- 烷基, S- 芳基, SO- 烷基, SO- 芳基, SO<sub>2</sub>- 烷基, SO<sub>2</sub>- 芳基, SO<sub>2</sub>H, SCF<sub>3</sub>, CN, 卤素, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>u</sub>NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>, SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH- 烷基和 OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>N( 烷基 )<sub>2</sub>;

[0128] Z = 1, 2, 3, 4, 5 或 6 。

[0129] 另外的抗微生物化合物也先前披露于美国专利 8,106,031, 和国际专利申请 WO 2007/131072A2 中, 将其全部内容在此引入以作参考。

[0130] 在一些实施方式中, 本发明的挥发性抗微生物化合物具有式 (IV) 的结构 :

[0131]



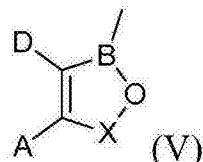
[0132] 其中 A 和 D 与它们所连接的碳原子共同形成 5-、6- 或 7- 元稠环, 所述稠环可以通过以下基团取代 :C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷氧基, 羟基, 卤素, 硝基, 脂基, 氨基, 由一个或多个 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷基取代的氨基, 羧基, 酰基, 芳氧基, 碳酰胺基, 由 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷基取代的碳酰胺基, 磺酰胺基或三氟甲基, 或所述稠环可以连接两个氧硼戊环;

[0133] X 为基团 -CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, 其中 R<sup>7</sup>和 R<sup>8</sup>各自独立地为氢, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷基, 脂基, 硝基, 芳基, 芳烷基, 或 R<sup>7</sup>和 R<sup>8</sup>与它们所连接的碳原子共同形成脂环; 和

[0134] R<sup>6</sup>为氢, C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>- 烷基, 由 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷氧基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷硫基取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>- 烷基, 羟基, 氨基, 由 C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>- 烷基取代的氨基, 羧基, 芳基, 芳氧基, 碳酰胺基, 由 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷基取代的碳酰胺基, 芳基或芳烷基, 芳烷基, 芳基, 杂芳基, 环烷基, C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>- 亚烷基氨基, 由苯基取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>- 亚烷基氨基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷氧基或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷硫基, 羰基亚烷基氨基或自由基

[0135] 具有式 (IV) 的结构:

[0136]

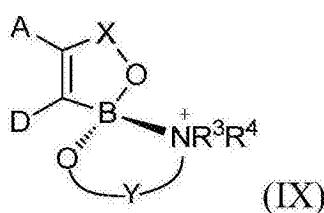


[0137] 其中 A、D 和 X 为前文中定义, 不同之处在于 2-(羟甲基) 苯硼酸环状单酯 (boronophthalide);

[0138] 及其农用盐。

[0139] 在一个实施方式中, 本发明的挥发性抗微生物化合物具有式 (IX) 的结构:

[0140]



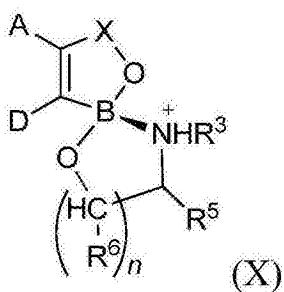
[0141] 其中 A, D, 和 X 为以上所定义;

[0142] Y 为包含至多 18 个碳原子的二价亚烷基连接基团或包含至多 18 碳原子的二价亚烷基连接基团 (其由苯基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷氧基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷硫基) ; 羰基亚烷基氨基取代; 和

[0143] R<sup>3</sup>和 R<sup>4</sup>各自独立地为氢, C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>- 烷基或苯基, 或 R<sub>3</sub>与 Y 或部分 Y 一起形成 5-, 6- 或 7- 元环, 其包含氮原子。

[0144] 在另一个实施方式中, 本发明的挥发性抗微生物化合物具有式 (X) 的结构:

[0145]



[0146] 其中 A, D, 和 X 为以上所定义；

[0147] n 为 1, 2, 或 3；

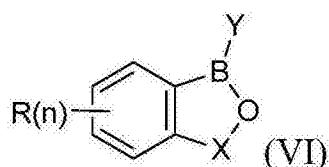
[0148] R<sup>3</sup>为氢, C<sub>1</sub>—C<sub>18</sub>—烷基或苯基；和

[0149] R<sup>5</sup>和 R<sup>6</sup>各自独立地为氢, 包含至多总数为 16 个碳原子的烷基, 或苯基。

[0150] 另外的抗微生物化合物也先前披露于美国专利 5,880,188 中, 将其全部内容在此引入以作参考。

[0151] 另一方面, 提供使用挥发性抗微生物化合物抵抗影响肉类、植物或植物部分的病原体的方法。所述方法包括将所述肉类、植物或植物部分与有效量的式 (VI) 的挥发性抗微生物化合物及其农用盐接触：

[0152]



[0153] 其中每个 R 独立地为氢, 烷基, 烯, 炔, 卤代烷基, 卤代烯基, 卤代炔基, 烷氧基, 烯氧基, 卤代烷氧基, 芳基, 杂芳基, 芳烷基, 芳基烯基, 芳基炔基, 杂芳烷基, 杂芳基烯基, 杂芳基炔基, 卤素, 羟基, 脂基, 胺, 酯, 羧酸, 酮, 醇, 硫醚, 亚砜, 砜, 磺基肟, 硫亚胺, 磺酰胺, 硫酸酯, 磺酸酯, 硝基烷基, 酰胺, 肪, 亚胺, 羟基胺, 肽, 胍, 氨基甲酸酯, 硫代氨基甲酸酯, 脲, 硫脲, 碳酸酯, 芳氧基, 或杂芳基氧基；

[0154] n = 1, 2, 3, 或 4；

[0155] B 为硼；

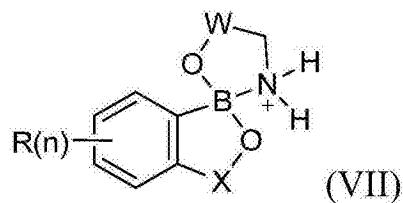
[0156] X = (CR<sub>2</sub>)<sub>m</sub>, 其中 m = 1, 2, 3, 或 4；

[0157] Y 为烷基, 烯, 炔, 卤代烷基, 卤代烯基, 卤代炔基, 烷氧基, 烯氧基, 卤代烷氧基, 芳基, 杂芳基, 芳烷基, 芳基烯基, 芳基炔基, 杂芳烷基, 杂芳基烯基, 杂芳基炔基, 羟基, 脂基, 胺, 酯, 羧酸, 酮, 醇, 硫醚, 亚砜, 砜, 磺基肟, 硫亚胺, 磺酰胺, 硫酸酯, 磺酸酯, 硝基烷基, 酰胺, 肪, 亚胺, 羟基胺, 肽, 胍, 氨基甲酸酯, 硫代氨基甲酸酯, 脲, 硫脲, 碳酸酯, 芳氧基, 或杂芳基氧基；

[0158] 条件是当 Y 为羟基时, R 不是芳氧基, 或杂芳基氧基。

[0159] 在一个实施方式中, 挥发性抗微生物化合物具有式 (VII) 的结构：

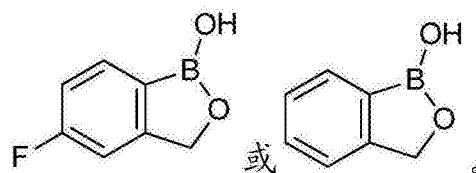
[0160]



[0161] 其中  $W = (CH_2)_n$ , 其中为 1, 2, 或 3。

[0162] 在另一个实施方式中, 挥发性抗微生物化合物具有以下结构:

[0163]



[0164] 在所提供的方法的一个实施方式中, 所述病原体选自: 链格孢属 (*Alternaria* spp.), 曲霉属 (*Aspergillus* spp.), 葡萄座腔菌属 (*Botryosphaeria* spp.), 葡萄孢属 (*Botryotis* spp.), 丝衣霉属 (*Byssochlamys* spp.), 刺盘孢属 (*Colletotrichum* spp.), 色二孢属 (*Diplodia* spp.), 镰刀菌属 (*Fusarium* spp.), 地菌属 (*Geotrichum* spp.), 毛双孢属 (*Lasiodiplodia* spp.), 链核盘菌属 (*Monilinia* spp.), 毛霉菌属 (*Mucor* spp.), 青霉菌属 (*Penicillium* spp.), 无柄盘菌属 (*Pezicula* spp.), 拟茎点霉属 (*Phomopsis* spp.), 疫病菌属 (*Phytophthora* spp.), 腐霉属 (*Pythium* spp.), 丝核菌属 (*Rhizoctonia* spp.), 根霉属 (*Rhizopus* spp.), 核盘菌属 (*Sclerotinia* spp.), 和 黑星病菌属 (*Venturia* spp.)。在另一个实施方式中, 所述病原体选自: 欧文氏菌属 (*Erwinia* spp.), (*Pectobacterium* spp.), 假单胞菌属 (*Pseudomonas* spp.), 萎焉 (*Ralstonia* spp.), 黄单胞菌属 (*Xanthomonas* spp.), 沙门氏菌属 (*Salmonella* spp.), 大肠杆菌属 (*Escherichia* spp.), 李斯特菌属 (*Listeria* spp.), 芽孢杆菌属 (*Bacillus* spp.), 志贺菌属 (*Shigella* spp.), 和葡萄球菌属 (*Staphylococcus* spp.) 在另一个实施方式中, 所述病原体选自: 念珠菌属 (*candida* spp.), 德巴利酵母属 (*Debaryomyces* spp.), 芽孢杆菌属 (*Bacillus* spp.), 弯曲菌属 (*Campylobacter* spp.), 梭状芽孢杆菌属 (*Clostridium* spp.), 隐孢子虫属 (*Cryptosporidium* spp.), 贾第鞭毛虫属 (*Giardia* spp.), 弧菌属 (*Vibrio* spp.), 和尔森氏菌属 (*Yersinia* spp.) 在另一个实施方式中, 所述方法包括收获前处理或收获后处理。在一个进一步的实施方式中, 所述收获前处理选自: 种子处理和移植处理。在另一个实施方式中, 所述收获后处理选自: 现场包装期间的处理; 货盘化期间的处理, 箱式处理, 运输期间的处理, 和储存期间的处理和 / 或整个销售网络。

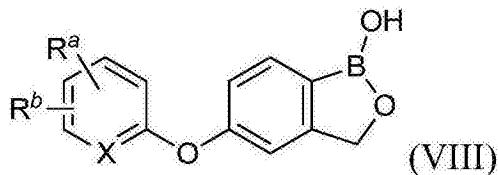
[0165] 在另一个实施方式中, 植物或植物部分包含转基因植物或转基因植物部分。在另一个实施方式中, 植物或植物部分选自玉米, 小麦, 棉花, 稻, 大豆, 和低芥酸油菜。在另一个实施方式中, 植物或植物部分选自水果, 蔬菜, 苗圃, 草坪, 和观赏作物。在一个进一步的实施方式中, 所述水果选自: 香蕉, 菠萝, 柑橘属 (包括橙, 柠檬, 酸柠檬, 葡萄柚, 和其它柑橘), 葡萄, 西瓜, 棱瓜, 香瓜, 和其它甜瓜, 苹果, 桃, 梨, 樱桃, 猕猴桃, 芒果, 油桃, 番石榴, 番木瓜, 柿子, 石榴, 油梨, 无花果, 和浆果 (包括草莓, 越橘, 覆盆子, 黑莓, 穗醋栗, 和其它类型的浆果)。在一个进一步的实施方式中, 蔬菜选自: 番茄, 番茄, 甘薯, 木薯, 胡椒, 铃状椒, 胡萝卜, 芹菜, 笋瓜, 茄子, 甘蓝, 菜花, 绿菜花, 芦笋, 蘑菇, 洋葱, 大蒜, 扁叶葱, 和食荚菜豆。

一个进一步的实施方式中，花或花部分选自：玫瑰，康乃馨，兰花，老鹳草属植物，百合或其它观赏花卉。一个进一步的实施方式，肉类选自牛肉，野牛，小鸡，鹿，山羊，火鸡，猪肉，羊，鱼，水生有壳动物，软体动物，或干腌肉制品。

[0166] 在一个实施方式中，所述接触包括通过选自以下的方式施用挥发性抗微生物化合物：喷雾，下雾，热起雾或非热起雾，浸湿，气体处理，及其组合。在一个进一步的实施方式中，所述气体处理选自：从香囊释放，从合成膜或天然膜，纤维材料释放，和 / 或从衬垫或其它包装材料释放，从粉剂释放，从释放气体的发生器释放，使用压缩气瓶或非压缩气瓶释放，从箱内的液滴释放，及其组合。在另一个实施方式中，所述方法进一步包括接触所述肉类、植物、植物部分与环丙烯化合物。在一个进一步的实施方式中，环丙烯化合物含有 1- 甲基环丙烯 (1-MCP)。

[0167] 另一方面，提供使用挥发性抗微生物化合物抵抗影响肉类、植物或植物部分的病原体的方法。所述方法包括将所述肉类、植物或植物部分与有效量的式 (VIII) 的挥发性抗微生物化合物及其农用盐接触：

[0168]



[0169] 其中  $R^a$  为  $CN$ ,  $C(O)NR^{10}$  或  $C(O)OR^{11}$ , 其中  $R^{11}$  为氢, 取代烷基, 或未取代烷基,

[0170]  $X$  为  $N$ ,  $CH$  和  $CR^b$ ;

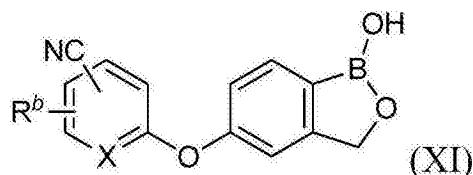
[0171]  $R^b$  为卤素, 取代或未取代烷基,  $C(O)R^{12}$ ,  $C(O)OR^{12}$ ,  $OR^{12}$ ,  $NR^{12}R^{13}$ , 其中  $R^9$ ,  $R^{10}$ ,  $R^{12}$ , 和  $R^{13}$  独立地为氢, 取代或未取代烷基, 取代或未取代杂烷基, 取代或未取代环烷基, 取代或未取代杂环烷基, 取代或未取代芳基, 或取代或未取代杂芳基;

[0172] 条件是  $R^9$  和  $R^{10}$ , 与它们所连接的碳, 任选地组合形成 4- 至 8- 元取代或未取代杂环烷基环;

[0173] 并且条件是  $R^{12}$  和  $R^{13}$ , 与它们所连接的碳, 任选地组合形成 4- 至 8- 元取代或未取代杂环烷基环。

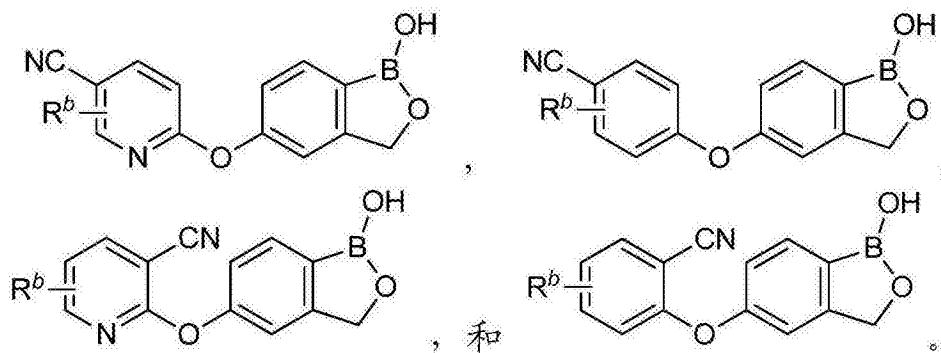
[0174] 在一个实施方式中，本发明的挥发性抗微生物化合物具有式 (XI) 的结构：

[0175]



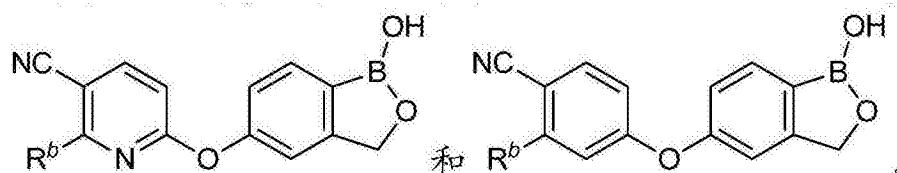
[0176] 在另一个实施方式中，本发明的挥发性抗微生物化合物选自以下：

[0177]



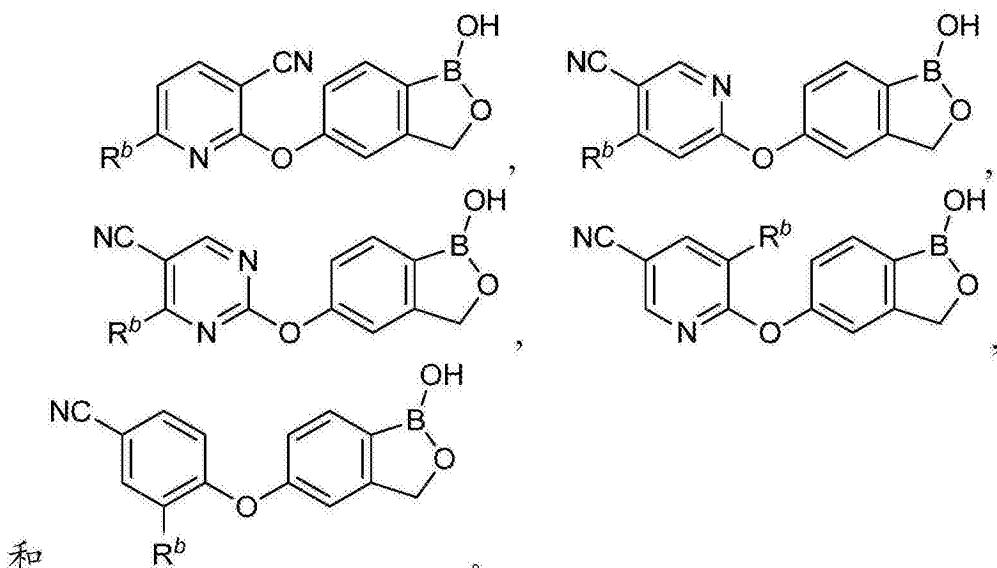
[0178] 在另一个实施方式中，本发明的挥发性抗微生物化合物选自以下：

[0179]



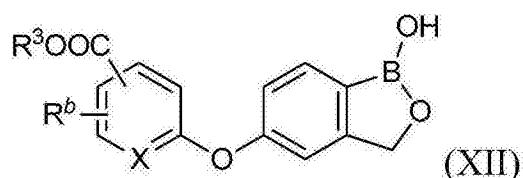
[0180] 在另一个实施方式中，本发明的挥发性抗微生物化合物选自以下：

[0181]



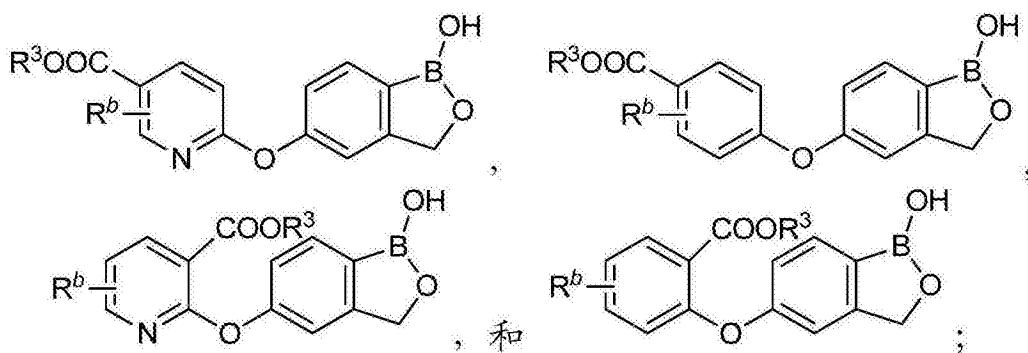
[0182] 在一个实施方式中，本发明的挥发性抗微生物化合物具有式 (XII) 的结构：

[0183]



[0184] 在另一个实施方式中，本发明的挥发性抗微生物化合物选自以下：

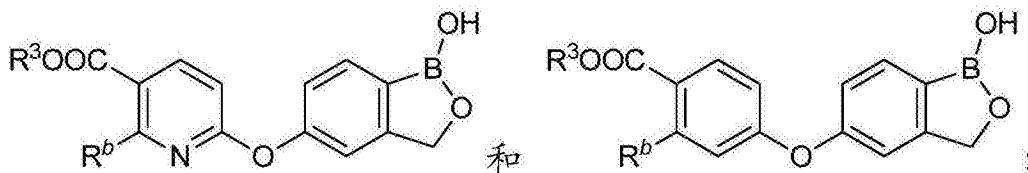
[0185]



[0186] 其中  $R^3$  为氢, 取代或未取代烷基或取代或未取代杂烷基。

[0187] 在另一个实施方式中, 本发明的挥发性抗微生物化合物选自以下:

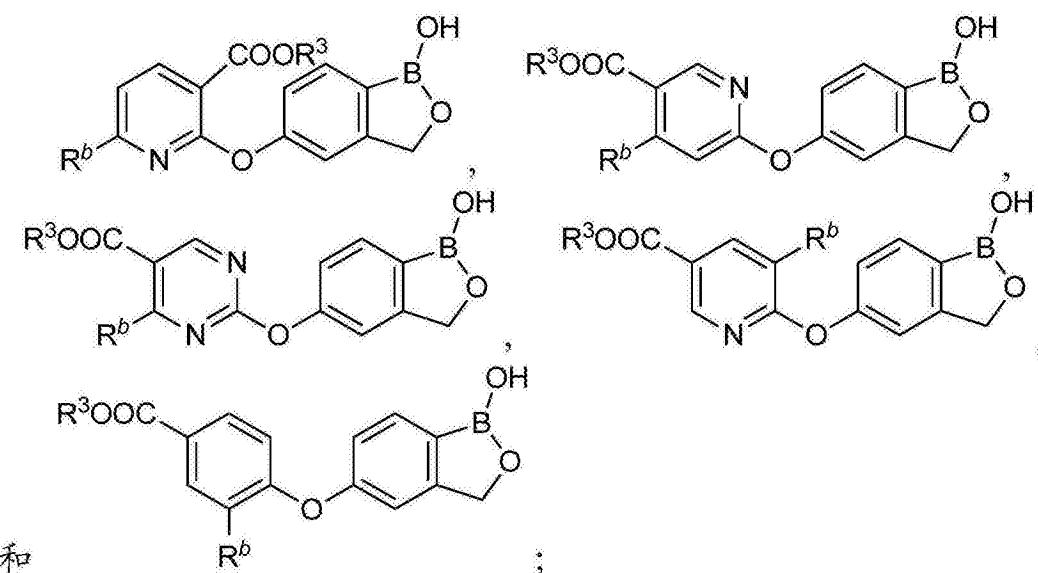
[0188]



[0189] 其中  $R^3$  为氢, 取代或未取代烷基或取代或未取代杂烷基。

[0190] 在另一个实施方式中, 本发明的挥发性抗微生物化合物选自以下:

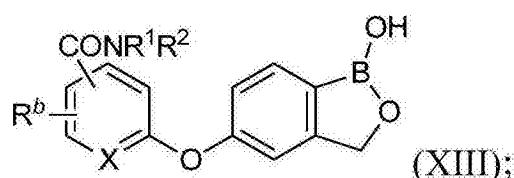
[0191]



[0192] 其中  $R^3$  为氢, 取代或未取代烷基或取代或未取代杂烷基。

[0193] 在一个实施方式中, 本发明的挥发性抗微生物化合物具有式 (XIII) 的结构:

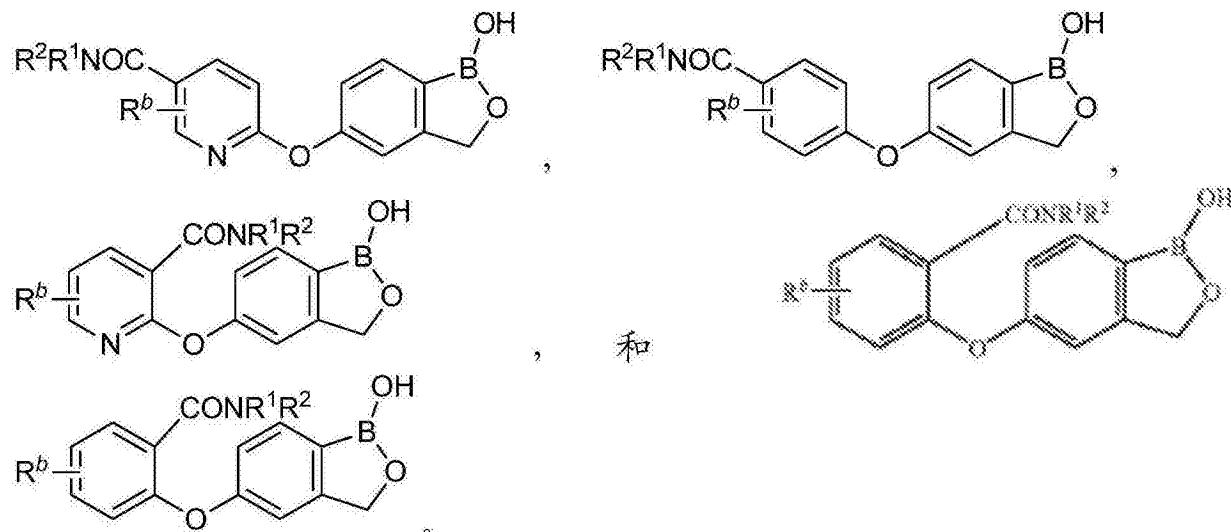
[0194]



[0195] 其中每个  $R^1$  和  $R^2$  独立地为氢, 取代或未取代烷基或取代或未取代杂烷基。

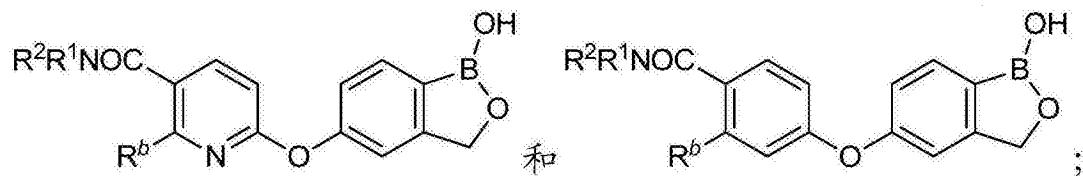
[0196] 在另一个实施方式中, 本发明的挥发性抗微生物化合物选自以下:

[0197]



[0198] 在另一个实施方式中，本发明的挥发性抗微生物化合物选自以下：

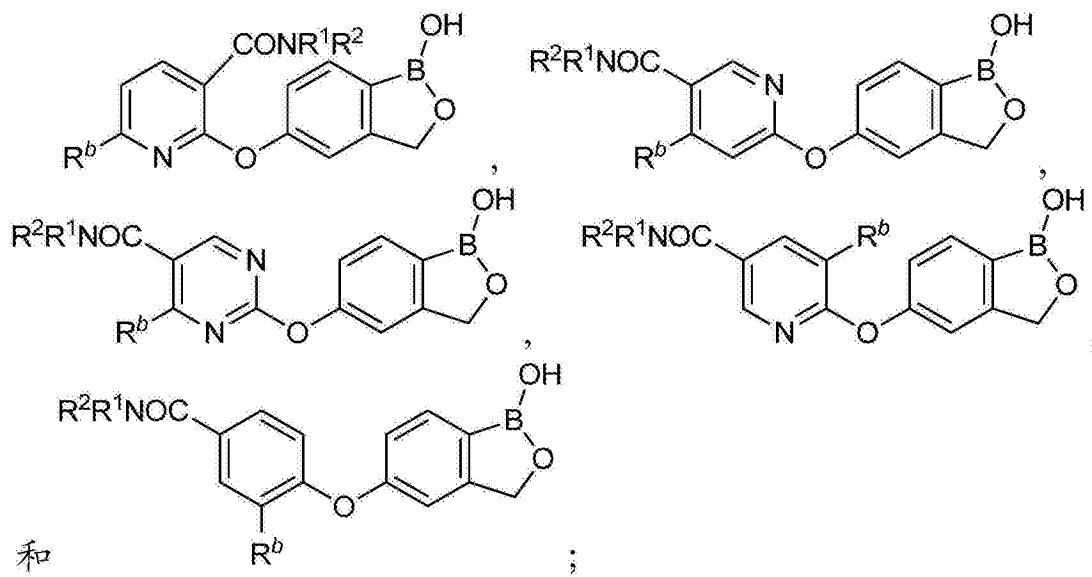
[0199]



[0200] 其中每个 R<sup>1</sup>和 R<sup>2</sup>独立地为氢，取代或未取代烷基或取代或未取代杂烷基。

[0201] 在另一个实施方式中，本发明的挥发性抗微生物化合物选自以下：

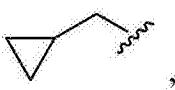
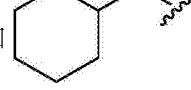
[0202]



[0203] 其中每个 R<sup>1</sup>和 R<sup>2</sup>独立地为氢，取代或未取代烷基或取代或未取代杂烷基。

[0204] 在一个实施方式中，R<sup>b</sup>选自氟和氯。在另一个实施方式中，R<sup>b</sup>为选自 OR<sup>26</sup>和 NR<sup>27</sup>R<sup>28</sup>。在另一个实施方式中，当时 R<sup>b</sup>为 OR<sup>26</sup>，R<sup>26</sup>选自 H，取代或未取代烷基，取代或未取代杂烷基，取代或未取代环烷基，取代或未取代杂环烷基，取代或未取代芳基，和取代或未取代杂芳基。在另一个实施方式中，当 R<sup>b</sup>为 OR<sup>26</sup>时，R<sup>26</sup>选自 H，取代或未取代烷基，取代或未取代杂

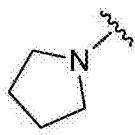
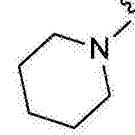
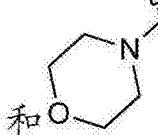
烷基和取代或未取代环烷基。在另一个实施方式中，当时<sup>b</sup>为OR<sup>26</sup>，R<sup>26</sup>为未取代C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基。在另一个实施方式中，当R<sup>b</sup>为OR<sub>26</sub>时，R<sub>26</sub>为未取代环烷基。在另一个实施方式中，当R<sup>b</sup>为OR<sup>26</sup>时，R<sup>26</sup>为烷基，其由选自取代或未取代C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基的单元取代。在另一个实施方式中，当R<sup>b</sup>为OR<sup>26</sup>时，R<sup>26</sup>为烷基，其由至少一个卤素取代。在另一个实施方式中，当R<sup>b</sup>为OR<sup>26</sup>时，R<sup>26</sup>为烷基，其由至少一个含氧基团取代。

[0205] 在另一个实施方式中，当R<sup>b</sup>为OR<sup>26</sup>时，R<sup>26</sup>为选自以下的单元：-CH<sub>3</sub>，-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>，-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>，-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>，-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>，-CH<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>，-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(OH)，-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(OCH<sub>3</sub>)，-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(OC(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>)，-C(O)CH<sub>3</sub>，-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OC(O)CH<sub>3</sub>，-CH<sub>2</sub>C(O)OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>，-CH<sub>2</sub>C(O)OC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>，-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>C(O)CH<sub>3</sub>，-CH<sub>2</sub>C(O)OC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>，环戊基，环己基，，，和。

[0206] 在另一个实施方式中，当R<sup>b</sup>为NR<sup>27</sup>R<sup>28</sup>时，R<sup>27</sup>和R<sup>28</sup>为独立选自以下的单元：H，取代或未取代烷基，取代或未取代杂烷基，取代或未取代环烷基，取代或未取代杂环烷基，取代或未取代芳基，和取代或未取代杂芳基。在另一个实施方式中，当R<sup>b</sup>为NR<sup>27</sup>R<sup>28</sup>时，R<sup>27</sup>为H或未取代烷基；和R<sup>28</sup>为未取代烷基或由选自羟基，苯基，未取代烷氧基的单元取代的烷基，和由苯基取代的烷氧基。在一个进一步的实施方式中，当R<sup>b</sup>为NR<sup>27</sup>R<sup>28</sup>时，R<sup>27</sup>为H或CH<sub>3</sub>。

[0207] 在另一个实施方式中，当R<sup>b</sup>为NR<sup>27</sup>R<sup>28</sup>时，R<sup>27</sup>和R<sup>28</sup>独立地选自以下：取代或未取代烷基。在另一个实施方式中，当R<sup>b</sup>为NR<sup>27</sup>R<sup>28</sup>时，R<sup>27</sup>为未取代烷基；和R<sup>28</sup>为取代或未取代烷基。在另一个实施方式中，当R<sup>b</sup>为NR<sup>27</sup>R<sup>28</sup>时，R<sup>27</sup>为未取代烷基；和R<sup>28</sup>为烷基，其由选自取代或未取代烷氧基和羟基的单元取代。在另一个实施方式中，当R<sup>b</sup>为NR<sup>27</sup>R<sup>28</sup>时，R<sup>27</sup>为未取代烷基；和R<sup>28</sup>为烷基，其由未取代烷氧基取代。在另一个实施方式中，当R<sup>b</sup>为NR<sup>27</sup>R<sup>28</sup>时，R<sup>27</sup>为未取代烷基；和R<sup>28</sup>为由烷氧基取代，由苯基取代的烷基。在另一个实施方式中，当R<sup>b</sup>为NR<sup>27</sup>R<sup>28</sup>时，R<sup>27</sup>为未取代烷基；和R<sup>28</sup>为烷基，其由未取代烷氧基取代。在另一个实施方式中，当R<sup>b</sup>为NR<sup>27</sup>R<sup>28</sup>时，R<sup>27</sup>和R<sup>28</sup>与它们所连接的氮一起，组合形成4-至8-元取代或未取代杂环烷基环。在另一个实施方式中，当R<sup>b</sup>为NR<sup>27</sup>R<sup>28</sup>时，R<sup>27</sup>和R<sup>28</sup>与它们所连接的氮一起，组合形成5-或6-元取代或未取代杂环烷基环。

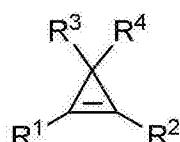
[0208] 在另一个实施方式中，R<sup>b</sup>选自N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>，N(CH<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(OCH<sub>3</sub>)，N(CH<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH)，NH<sub>2</sub>，NHCH<sub>3</sub>，NH(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(OCH<sub>3</sub>)，NH(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(OCH<sub>2</sub>Ph)，NH(CH<sub>2</sub>Ph)，NH(C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>)和NH(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH)。

在另一个实施方式中，R<sup>b</sup>选自，，和。

[0209] 另外的抗微生物化合物也先前披露于美国专利8,039,450，和专利申请公开公US 2009/0291917中，将其全部内容在此引入以作参考。

[0210] 实施本发明涉及一种或多种环戊烯化合物的用途。本申请中所用的环丙烯化合物为具有下式的任何化合物：

[0211]



[0212] 其中每个 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>和 R<sup>4</sup>独立选自包含 H 和下式的化学基团的基团：

[0213] -(L)<sub>n</sub>-Z

[0214] 其中 n 为 0 至 12 的整数。每个 L 为二价基团。合适的 L 基团包括,例如,自由基包含一个或多个选自 H, B, C, N, O, P, S, Si 或其混合物的原子。具有 L 基团的原子可以通过单键,双键,三键或其混合键相互连接。每个 L 基团可以为线性,支化,环状或其组合。在任何一个 R 基团(即, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>和 R<sup>4</sup>中的任何一个)中,杂原子(即,不是 H 或 C 的原子)的总数为 0 至 6。独立地,在任何一个 R 基团中,非氢原子总数为 50 或更少。每个 Z 为单价基团。每个 Z 独立选自:氢,卤代,氰基,硝基,亚硝基,叠氮基,氯酸根,溴酸根,碘酸根,异氰酰,异腈基(isocyanido),异硫代氰酰,五氟硫代(pentafluorothio),和化学基团 G,其中 G 为 3- 至 14- 元环体系。

[0215] R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, 和 R<sup>4</sup>基团独立地选自合适的基团。适用作 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, 和 R<sup>4</sup>中一个或多个的基团尤其例如,脂族基团,脂族 - 氧基,烷基膦酸根(alkylphosphonato)基团,环脂族基团,环烷基磺酰基,环烷基氨基,杂环基团,芳基,杂芳基,卤素,甲硅烷基,其它基团,和混合物及其组合。适用作 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, 和 R<sup>4</sup>中一个或多个的基团可以是取代的或未取代的。

[0216] 合适的 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, 和 R<sup>4</sup>基团尤其例如脂族基团。一些合适的脂族基团包括例如,烷基,烯基,和炔基基团。合适的脂族基团可以为线性,支化,环状或其组合。独立地,合适的脂族基团可以是取代的或未取代的。

[0217] 如果目的化学基团的一个或多个氢原子通过取代基取代,则认为本申请中所用的目的化学基团是“取代的”。

[0218] 合适的 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, 和 R<sup>4</sup>基团也尤其例如取代的和未取代杂环基团,其通过插入的氨基,氨基,羧基或磺酰基连接至环丙烯化合物;这种 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, 和 R<sup>4</sup>基团的实例为杂环氧基,杂环羧基,二杂环氨基,和二杂环氨基磺酰基。

[0219] 合适的 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, 和 R<sup>4</sup>基团也尤其例如取代的和未取代杂环基团,其通过插入的氨基,氨基,羧基,磺酰基,硫代烷基或氨基磺酰基连接至环丙烯化合物;这种 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, 和 R<sup>4</sup>基团的实例为二杂芳基氨基,杂芳基硫代烷基,和二杂芳基氨基磺酰基。

[0220] 合适的 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, 和 R<sup>4</sup>基团也尤其例如,氢,氟,氯,溴,碘,氰基,硝基,亚硝基,叠氮基,氯酸根,溴酸根,碘酸根,异氰酰,异腈基,异硫代氰酰,五氟硫代,乙酰氧基,乙氧羧基(carboethoxy),氰酰,硝酸基,亚硝酸基,高氯酸根(perchlorato),丙二烯基(allenyl),丁基巯基,二乙基膦酸根,二甲基苯基甲硅烷基,异喹啉基,巯基,萘基,苯氧基,苯基,哌啶基,吡啶基,喹啉基,三乙基甲硅烷基,三甲基甲硅烷基,及其取代类似物。

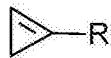
[0221] 本申请中所用的化学基团 G 为 3- 至 14- 元环体系。合适作为化学基团 G 的环体系可以是取代的或未取代的;它们可以是芳族(包括,例如苯基和萘基)或脂族(包括不饱和脂族,部分饱和脂族或饱和脂族);和它们可以是碳环型或杂环型。杂环 G 基团中,一些合适的杂原子例如,氮,硫,氧,及其组合。合适作为化学基团 G 的环体系可以是单环,双环,三环,多环,螺环或稠合环;作为双环,三环或稠合环的合适的化学基团 G 环体系中,单一化学基团 G 中的各个环可以全部为相同类型,或可以为两种或更多种类型(例如,芳族环可以与脂族环进行稠合)。

[0222] 在一个实施方式中,R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, 和 R<sup>4</sup>中的一个或多个氢或(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)烷基。在另一个实施方式中,每个 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, 和 R<sup>4</sup>均为氢或(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)烷基。在另一个实施方式中,每个 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>,

$R^3$ , 和  $R^4$  均为氢或 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 烷基。在另一个实施方式中, 每个  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ , 和  $R^4$  均为氢或甲基。在另一个实施方式中,  $R^1$  为 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 烷基, 每个  $R^2$ ,  $R^3$ , 和  $R^4$  均为氢。在另一个实施方式中,  $R^1$  为甲基, 每个  $R^2$ ,  $R^3$ , 和  $R^4$  均为氢, 并且环丙烯化合物在本申请中已知为 1- 甲基环丙烯或“1-MCP”。

[0223] 在另一个实施方式中, 环丙烯为下式 :

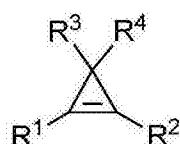
[0224]



[0225] 其中 R 为取代或未取代烷基, 烯基, 炔基, 环烷基, 环烷基烷基, 苯基或萘基; 其中取代基独立地为卤素, 烷氧基, 或取代或未取代苯氧基。在一个实施方式中, R 为 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> 烷基。在另一个实施方式中, R 为甲基。

[0226] 在另一个实施方式中, 环丙烯为下式 :

[0227]



[0228] 其中  $R^1$  为取代或未取代 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烯基, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 炔基, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 环烷基, 环烷基烷基, 苯基或萘基基团; 并且  $R^2$ ,  $R^3$ , 和  $R^4$  均为氢。在另一个实施方式中, 环丙烯含有 1- 甲基环丙烯 (1-MCP)。

[0229] 本申请中所用的短语“转基因载体”是指包含脱氧核糖核酸 (DNA) 插入片段的载体, 转录成信使核糖核酸 (mRNA) 或复制为宿主细胞内的核糖核酸 (RNA) 的“转基因”。短语“转基因”不仅是指转化成 RNA 的插入 DNA 的部分, 而且指转录或复制 RNA 所需的载体的那些部分。转基因典型地包含目的基因, 但不必需包含含有能够产生蛋白质的开放读框的多核苷酸序列。

[0230] 肉类、植物或植物部分在实施本发明时可以进行处理。一个实例为处理整株植物; 另一实例为处理整株植物同时将它们种植在土壤中, 在收获有用的植物部分之前。

[0231] 提供有用的植物部分的任何植物在实施本发明时可以进行处理。实例包括提供水果, 蔬菜, 和谷物的植物。

[0232] 本申请中所用的短语“植物”包括双子叶植物和单子叶植物。双子叶植物的实例包括烟草, 拟南芥 (Arabidopsis), 大豆, 番茄, 番木瓜, 低芥酸油菜, 向日葵, 棉花, 紫苜蓿, 番茄, 葡萄藤, 木豆 (pigeon pea), 豌豆, 芥属 (Brassica), 鹰嘴豆, 甜菜, 菜子, 西瓜, 甜瓜, 胡椒, 花生, 南瓜, 萝卜, 菠菜, 竹瓜, 绿菜花, 甘蓝, 胡萝卜, 菜花, 芹菜, 大白菜, 黄瓜, 茄子, 和莴苣。单子叶植物的实例包括谷物, 稻, 小麦, 甘蔗, 大麦, 黑麦, 高粱, 兰花, 竹, 香蕉, 香蒲, 百合, 燕麦, 洋葱, 小麦, 和小黑麦。水果的实例包括香蕉, 菠萝, 橙, 葡萄, 葡萄柚, 西瓜, 甜瓜, 苹果, 桃, 梨, 猕猴桃, 芒果, 油桃, 番石榴, 柿子, 油梨, 柠檬, 无花果, 和浆果。

[0233] 本领域技术人员会理解, 基于所提供的披露内容可能存在某些变型。因此, 以下实施例出于说明本发明的目的给出并且不应解释为对于本发明的范围或权利要求的限制。

[0234] 实施例

[0235] 实施例 1

[0236] 将 12- 孔 (7 毫升 (每个孔的按 mL 计的体积) 微量滴定板用于对于挥发性抗微生物化合物的体外抑制试验。将 3-mL 体积的全强度的 (full-strength) 番茄葡萄糖琼脂 (PDA) 添加至每个孔。冷却之后, 将 1 微升 ( $\mu$  L) 的  $1 \times 10^6$  每 mL 番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 孢子悬浮液点滴吸移至琼脂的中心。对于第一个实验, 使得接种板在 4°C 萌发 5 天。对于第二个实验, 将板在挥发性杀菌剂处理之前立即接种。将小的 Whatman#1 滤片 (Cat. No. 1001-0155) 一式两份放置在聚乙烯 PCR 板密封膜的下侧。

[0237]

表1. 对于挥发性杀菌剂的体外试验结果	
化合物A的配额 (每个片的mg数)	番茄灰霉( <i>Botrytis</i> )抑制%(体外)
1.25	100%
0.63	100%
0.31	100%
0.16	100%
0.08	100%
0.04	100%
0.023	100%
0.01	100%
0.005	100%
0.0024	85%
0.001	69%
0.0006	46%
对照	0%

[0238] 为了确定最小抑菌浓度 (MIC), 将化合物 A (苯硼酸半酯; 图 1) 在丙酮中稀释, 并且将适当量的化合物以剂量依赖的方式添加至片 (1.25 至 0.0006 毫克每片 (mg/ 片))。允许丙酮挥发 5 分钟。将番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 培养液周围的顶空然后通过具有含杀菌剂粘附片的膜密封在孔的内部。将板倒放在经处理的片上并且密封以防止任何化学品从片剥落并且落在经接种的琼脂上。在 4°C 储存 14 天之后, 评价培养物相对于对照物的生长百分比。不管孢子是否已经萌发 5 天或如果板接种之后不久开始处理 ( $\sim 15$  分钟); 有 100% 对照的真菌病原体降至 0.005mg。实验结果汇总于表 1 中。结果表明, 在相同浓度化合物 A 能够杀死番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 孢子并且抑制菌丝体生长。因此, 将化合物 A (图 1) 显示在配额为 0.005mg/ 片的 100% 体外抑制真菌生长的功效。

[0239] 实施例 2

[0240] 将总共 14 个抗微生物化合物使用实施例 1 中所述体外抑制试验进行试验。将全部 14 个化合物一式两份以剂量依赖的方式施用至 Whatman 片 (0.31 至 0.0006mg/ 片)。结果显示, 将化合物 A 提供最好的对照的番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*), 其中 100% 对照降至 0.005mg/ 片。其它化合物如化合物 C、化合物 D 和化合物 E, 分别使得 100% 对照降至 0.023, 0.04, 和 0.08mg/ 片。试验化合物显示于图 3 中。九个化合物的结果汇总于表 2 中,

其中其它五个化合物在试验范围内不显示检测活性。

[0241]

表2. 对于挥发性杀菌剂番茄灰霉抑制%的体外试验结果									
配额 (mg/片)	化合物 A	化合物 C	化合物 D	化合物 E	化合物 F	化合物 G	化合物 H	化合物 J	化合物 K
0.31	100%	100%	100%	100%	70%	100%	85%	50%	48%
0.16	100%	100%	100%	100%	53%	78%	80%	13%	29%
0.08	100%	100%	100%	100%	40%	43%	55%	8%	5%
0.04	100%	100%	100%	79%	18%	13%	38%	5%	0%
0.023	100%	100%	80%	79%	10%	3%	18%	0%	0%
0.01	100%	83%	70%	69%	8%	0%	3%	0%	0%
0.005	100%	63%	38%	38%	8%	0%	0%	0%	0%
0.0024	85%	43%	15%	28%	0%	0%	0%	0%	0%
0.001	69%	15%	0%	13%	0%	0%	0%	0%	0%
0.0006	46%	0%	0%	13%	0%	0%	0%	0%	0%
对照	0%	0%	0%	0%	0%	0%	0%	0%	0%

[0242] 实施例 3

[0243] 化合物 B(图 2;2-(羟甲基) 苯硼酸环状单酯, 将化合物 A 的脱氟类似物), 以上述实施例 1 和 2 的类似方式进行评价。将化合物以配额为 0.5mg 至 0.0039mg/ 片施用至 Whatman 滤纸。结果显示, 将化合物 B 在配额为 0.0078mg/ 片抑制 100% 的番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*)。

[0244] 实施例 4

[0245] 为了评估挥发性抗微生物化合物的体内活性, 使用绿色平葡萄开展挥发性生物测定。将水果单独放置在 20mL 闪烁管内部, 其中茎会朝上。将鲜茎伤口用 10 μL 的 1×106 每 mL 番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 孢子悬浮液接种。将 Whatman 滤纸 (Cat. No. 1822-024) 一式两份放置在瓶盖内部。为了确定 MIC, 将化合物 A(图 1) 在丙酮中稀释, 并且将适当量的化合物以剂量依赖的方式添加至所述片 (2.5 至 0.0024mg/ 片)。允许丙酮挥发 5 分钟。将瓶然后用含杀菌剂的盖盖住, 并且在 4°C 放置 14 天。储存之后, 评价水果的发病率和表观的植物毒性。结果汇总于表 3 中, 有 100% 对照的番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 降至 0.04mg/ 片, 在评价的任一配额没有植物毒性的迹象。使用化合物 A 的示例性体内抑制结果的代表性像片显示于图 4 中, 其中 0.04mg 的化合物 A 显示 100% 抑制, 0.0024mg 的化合物 A 显示不抑制。

[0246]

表3. 挥发性杀菌剂的体内试验结果	
对化合物A的配额 (每个片的mg数)	番茄灰霉抑制%(体内)
1.25	100%
0.63	100%
0.31	100%
0.16	100%
0.08	100%
0.04	100%
0.023	0%
0.01	0%
0.005	0%
0.0024	0%
对照	0%

[0247] 实施例 5

[0248] 为了评估挥发性抗微生物化合物的体内活性, 使用草莓开展挥发性生物测定。将两只水果放置在 240mL 罐内部, 其中花萼朝下。将新鲜伤口用 20  $\mu$ L 的 1×106 每 mL 番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 孢子悬浮液接种。将 Whatman 滤纸 (Cat. No. 1822-024) 一式两份放置在罐盖内部。为了确定 MIC, 将化合物 A(苯硼酸半酯; 图 1) 在丙酮中稀释, 并且将适当量的化合物以剂量依赖的方式添加至所述片 (2.5 至 0.005mg/ 片)。为了确定 MIC, 将化合物 B(苯硼酸半酯; 图 2) 在丙酮中稀释, 并且将适当量的化合物以剂量依赖的方式添加至所述片 (2.5 至 0.005mg/ 片)。允许丙酮挥发 5 分钟。将罐然后用含杀菌剂的盖盖住, 并且放置 5 天在 21°C。储存之后, 评价水果的发病率和严重程度以及表现的植物毒性。结果汇总于表 4 中。对于化合物 A 有 100% 对照的番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 降至 0.16mg/ 片, 对于化合物 B 有 100% 对照的番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 降至 0.32mg/ 片, 在评价的任一配额没有植物毒性的迹象。

[0249]

表4. 草莓(体内)上番茄灰霉病菌( <i>Botrytis cinerea</i> )的发病百分比(%)		
配额(mg/片)	化合物A	化合物B
0.005	75%	100%
0.01	100%	100%
0.02	50%	100%
0.04	75%	75%
0.08	0%	50%
0.16	0%	25%
0.32	0%	0%
0.64	0%	0%
1.25	0%	0%
2.5	0%	0%

## [0250] 实施例 6

[0251] 为了评估挥发性抗微生物化合物的体内剂量随时间的活性, 使用草莓开展挥发性生物测定。将两只水果放置在 240mL 罐内部, 其中花萼朝下。将新鲜伤口用 20 μL 的 1×106 每 mL 番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 孢子悬浮液接种。将 Whatman 滤纸 (Cat. No. 1822-024) 一式两份放置在罐盖内部。将化合物 A (苯硼酸半酯; 图 1) 在丙酮中稀释, 并且将适当量的化合物以两个配额为 0.008 或 0.125mg 添加至所述片。允许丙酮蒸发 5 分钟。将罐用含杀菌剂的盖盖住, 并且用挥发性杀菌剂接种 1, 3, 6, 24 或 72 小时。接种之后, 将包含具有化合物 A 的片的盖用不具有化合物 A 的新盖替换。将所有样品在 21°C 保持 3 天, 然后将盖移除并且保持另外 48 小时, 全部在 90% 相对湿度 (R. H.)。评价水果的发病率和严重程度以及表观的植物毒性。结果汇总于表 5 中。对于化合物 A 在 0.125mg/ 片在 6 小时暴露之后有 100% 对照的番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*), 并且没有植物毒性的迹象。与丙酮唯一的对照相比, 0.125mg 的化合物 A 显示 100% 体内抑制。代表性结构也显示于图 5 中。

## [0252]

表5. 草莓上随时间的番茄灰霉病菌( <i>Botrytis cinerea</i> )的发病率(%)和严重程度				
化合物A	发病率(%)		严重程度(0至3)	
配额(mg/片)	0.008	0.125	0.008	0.125
时间(h)				
1	100%	67%	4.0	2.3
3	0%	33%	0.0	1.3
6	33%	0%	1.0	0.0
24	67%	0%	2.3	0.0
72	33%	0%	1.0	0.0

## [0253] 严重程度 :

[0254] 0 = 没有真菌生长

- [0255] 1 = 轻微感染 (<5 毫米 (mm) 直径)
- [0256] 2 = 中度感染 (<1 厘米 (cm) 直径)
- [0257] 3 = 高度感染 (>1cm 直径)
- [0258] 4 = 极度感染 (> 半长的水果)

[0259] 实施例 7

[0260] 将 12- 孔 (每个孔 7mL 体积) 微量滴定板用于挥发性抗微生物化合物的体外抑制试验。将 3-mL 体积的全强度的 LB 琼脂添加至每个孔。冷却之后, 将 15  $\mu$ L 的大肠杆菌 (*Escherichia coli*) 调节至光学密度为 0.02 至 0.035, 将进一步稀释的 1/10 吸移至琼脂的中心并且倾斜以均匀分布。将小的 Whatman#1 滤片 (Cat. No. 1001-0155) 一式两份放置在聚乙烯聚合酶链反应 (PCR) 板密封膜的下侧。为了确定最小抑菌浓度 (MIC), 将化合物 A (苯硼酸半酯; 图 1) 在丙酮中稀释, 将 5mg 的化合物添加至片。允许丙酮挥发 5 分钟。将大肠杆菌培菌液周围的顶空然后通过具有含杀菌剂粘附片的膜密封在孔的内部。将板倒放在经处理的片上并且密封以防止任何化学品从片剥落并且落在经接种的琼脂上。在 4°C 储存 3 天之后, 将培养物转移至 23°C 另外 2 天, 然后评价相对于对照的菌落生长。实验结果汇总于表 6 中。结果表明, 化合物 A 能够抑制大肠杆菌。

[0261]

表6. 对于挥发性杀菌剂的体外试验结果

对化合物A的配额 (每个片的mg数)	菌落评定
5.00	1
未处理	3
未接种	0

[0262] 菌落评定 :

- [0263] 0 = 没有菌落
- [0264] 1 = 微菌落未连接
- [0265] 2 = 小菌落有些合并
- [0266] 3 = 大菌落合并在一起

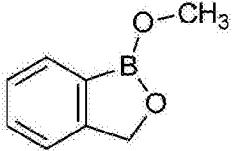
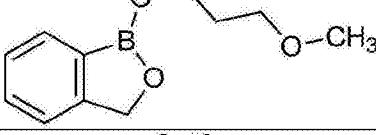
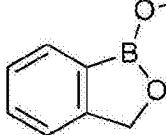
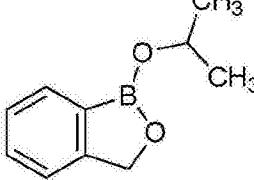
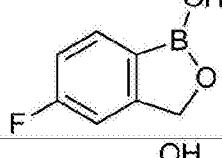
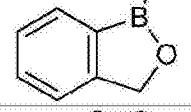
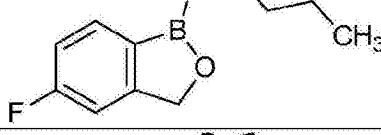
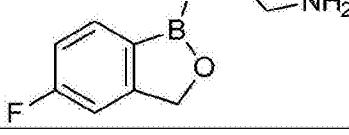
[0267] 实施例 8

[0268] 将 12- 孔 (6.5 每个孔的按 mL 计的体积) 微量滴定板用于挥发性抗微生物化合物的体外抑制试验。将 3-mL 体积的全强度的番茄葡萄糖琼脂 (PDA) 添加至每个孔。冷却之后, 将 1  $\mu$ L 的 1×105 每 mL 番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*), 扩展青霉菌 (*Penicillium expansum*), 烟草赤星病菌 (*Alternaria alternata*), 桃褐腐病菌 (*Monilinia fructicola*) 或胶孢炭疽病菌 (*Glomerella cingulata*) 孢子悬浮液点滴吸移至琼脂的中心。将板在挥发性杀菌剂处理之前立即接种。将 Whatman#1 滤片 (Cat. No. 1001-0155) 一式两份放置在聚乙烯 PCR 板密封膜的下侧。为了确定最小抑菌浓度 (MIC), 将化合物在丙酮中稀释, 并且将适当量的化合物以剂量依赖的方式添加至所述片以实现最终的顶空浓度为 1142.9 至 0.6mg/L。允许丙酮挥发 5 分钟。将培菌液周围的顶空然后通过具有含杀菌剂粘附片的膜通过将板倒放在经处理的片上密封在孔的内部, 并且密封以防止任何化学品从片剥落并且落在经

接种的琼脂上。在 23°C 储存 3 天之后, 将培养物基于测量真菌菌落直径评价相对于对照的生长百分比。实验结果汇总于表 7 中。结果表明, 苯硼酸半酯化合物具有优异的抵抗五个经选择的植物真菌病原体的体外活性。

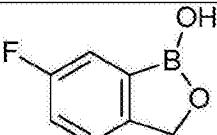
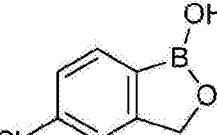
[0269]

表 7. MIC(mg/L, 顶空浓度)的许多苯硼酸半酯化合物用作挥发处理剂抵抗许多植物真菌病原体(化合物 10 与化合物 A 相同, 和化合物 11 与化合物 B 相同)。

结构 化 合 物 编 号	MIC(mg/L)				
	BOTRCI	PENIEX	ALTEAL	MONIFC	GLOMCI
	6	2.2	17.9	4.5	8.9
	7	2.2	17.9	8.9	8.9
	8	2.2	35.7	8.9	4.5
	9	2.2	8.9	8.9	8.9
	10	2.2	2.2	<0.6	<0.6
	11	4.5	17.9	4.5	2.2
	30	2.2	8.9	2.2	2.2
	34	<0.6	2.2	2.2	n/a

[0270]

表 7. MIC(mg/L, 顶空浓度)的许多苯硼酸半酯化合物用作挥发处理剂抵抗许多植物真菌病原体(化合物 10 与化合物 A 相同, 和化合物 11 与化合物 B 相同)。

结构	化 合 物 编 号	MIC(mg/L)				
		BOTRCI	PENIEX	ALTEAL	MONIFC	GLOMCI
	200	10.6	68.3	7.3	6.3	n/a
	201	3.8	29.5	16.1	8.5	9.3

[0271] BOTRCI = 番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) ( 灰霉病 )

[0272] PENIEX = 扩展青霉菌 (*Penicillium expansum*) ( 苹果蓝霉 )

[0273] ALTEAL = 烟草赤星病菌 (*Alternaria alternata*) ( 烟草赤星病 )

[0274] MONIFC = 桃褐腐病菌 (*Monilinia fructicola*) ( 苹果褐腐病 )

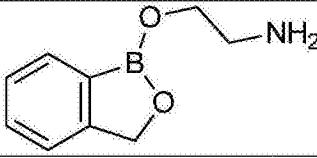
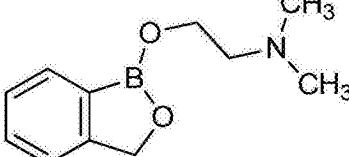
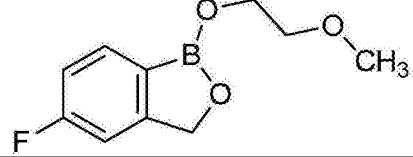
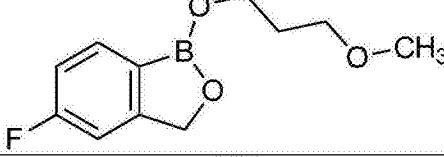
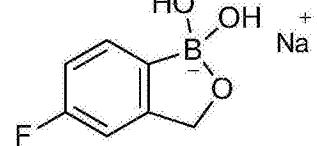
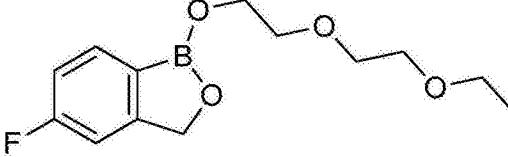
[0275] GLOMCI = 胶孢炭疽病菌 (*Glomerella cingulata*) ( 番椒炭疽病 )

[0276] 实施例 9

[0277] 将 12- 孔 (6.5 每个孔的按 mL 计的体积) 微量滴定板用于挥发性抗微生物化合物的体外抑制试验。将 3-mL 体积的全强度的番茄葡萄糖琼脂 (PDA) 添加至每个孔。冷却之后, 1  $\mu$ L 的 1×105 每 mL 番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 和扩展青霉菌 (*Penicillium expansum*) 孢子悬浮液点滴吸移至琼脂的中心。将板在挥发性杀菌剂处理之前立即接种。将 Whatman#1 滤片 (Cat. No. 1001-0155) 一式两份放置在聚乙烯 PCR 板密封膜的下侧。为了确定最小抑菌浓度 (MIC), 将化合物在丙酮中稀释, 并且将适当量的化合物以剂量依赖的方式添加至所述片以实现最终的顶空浓度为 35.7 至 0.03mg/L。允许丙酮挥发 5 分钟。将培菌液周围的顶空然后通过具有含杀菌剂粘附片的膜通过将板倒放在经处理的片上密封在孔的内部, 并且密封以防止任何化学品从片剥落并且落在经接种的琼脂上。在 23°C 储存 3 天之后, 将培养物基于测量真菌菌落直径评价相对于对照的生长百分比。实验结果汇总于表 8 中。结果表明, 许多苯硼酸半酯化合物具有优异的抵抗两种经选择的植物真菌病原体的体外活性。

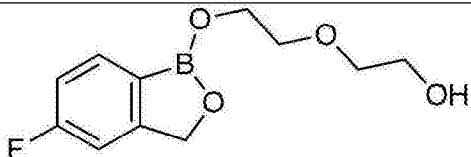
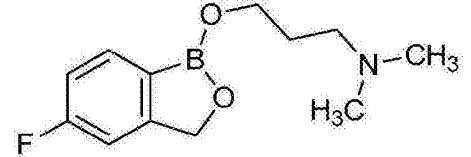
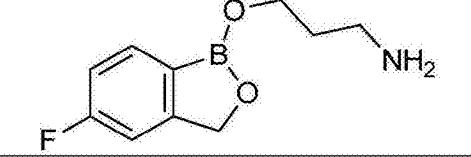
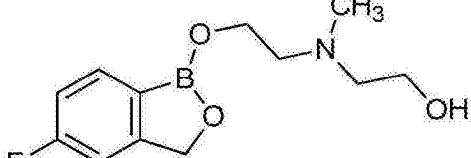
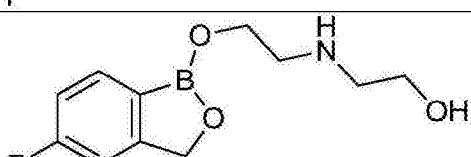
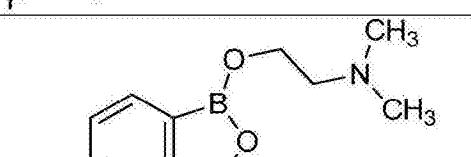
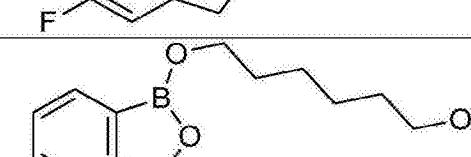
[0278]

表 8. MIC(mg/L)的许多苯硼酸半酯化合物用作挥发处理剂抵抗番茄灰霉病菌(*Botrytis cinerea*)和扩展青霉菌(*Penicillium expansum*)植物真菌病原体。

结构	化 合 物 编 号	MIC(mg/L)	
		BOTRCI	PENIEX
	21	1.1	35.7
	22	4.5	35.7
	38	0.6	8.9
	39	0.6	8.9
	54	0.6	4.5
	55	4.5	>35.7

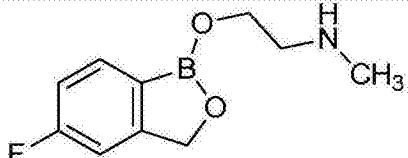
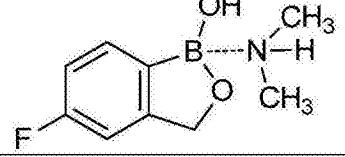
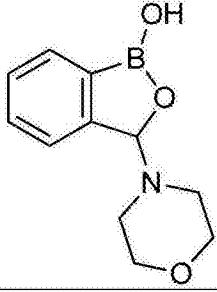
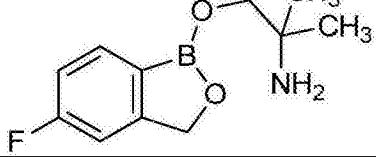
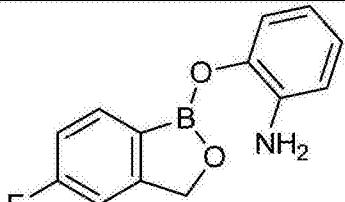
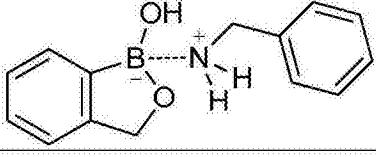
[0279]

表 8. MIC(mg/L)的许多苯硼酸半酯化合物用作挥发处理剂抵抗番茄灰霉病菌(*Botrytis cinerea*)和扩展青霉菌(*Penicillium expansum*)植物真菌病原体。

结构	化 合 物 编 号	MIC(mg/L)	
		BOTRCI	PENIEX
	62	2.2	8.9
	63	1.1	17.9
	64	1.1	8.9
	72	35.7	>35.7
	73	35.7	>35.7
	74	2.2	35.7
	86	0.6	8.9

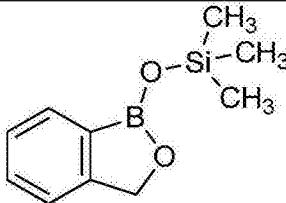
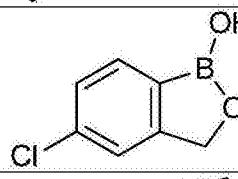
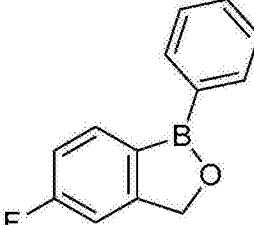
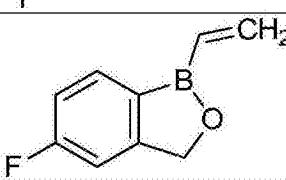
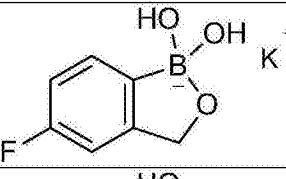
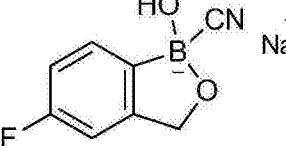
[0280]

表 8. MIC(mg/L)的许多苯硼酸半酯化合物用作挥发处理剂抵抗番茄灰霉病菌(*Botrytis cinerea*)和扩展青霉菌(*Penicillium expansum*)植物真菌病原体。

结构	化 合 物 编 号	MIC(mg/L)	
		BOTRCI	PENIEX
	87	0.6	8.9
	105	0.6	4.5
	114	17.9	>35.7
	115	0.6	8.9
	116	1.1	8.9
	121	4.5	17.9

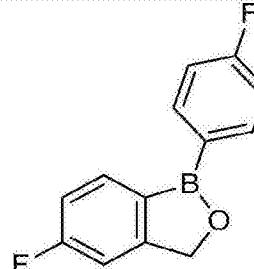
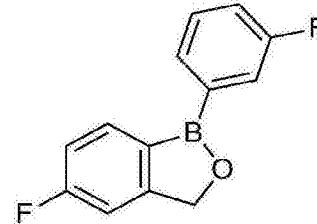
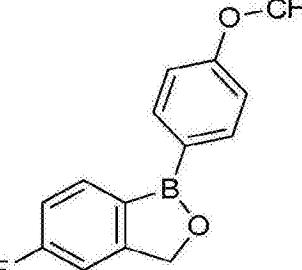
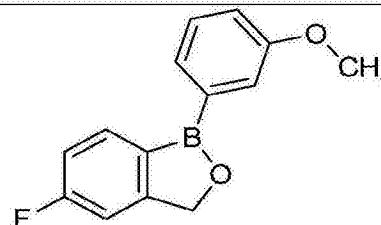
[0281]

表 8. MIC(mg/L)的许多苯硼酸半酯化合物用作挥发处理剂抵抗番茄灰霉病菌(*Botrytis cinerea*)和扩展青霉菌(*Penicillium expansum*)植物真菌病原体。

结构	化 合 物 编 号	MIC(mg/L)	
		BOTRCI	PENIEX
	122	2.2	17.9
	124	4.5	8.9
	127	2.2	4.5
	129	4.5	8.9
	130	1.1	4.5
	132	1.1	4.5

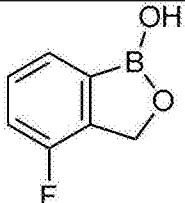
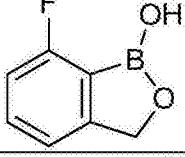
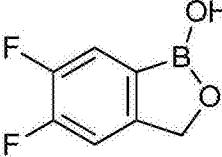
[0282]

表 8. MIC(mg/L)的许多苯硼酸半酯化合物用作挥发处理剂抵抗番茄灰霉病菌(*Botrytis cinerea*)和扩展青霉菌(*Penicillium expansum*)植物真菌病原体。

结构	化 合 物 编 号	MIC(mg/L)	
		BOTRCI	PENIEX
	133	8.9	35.7
	134	17.9	>35.7
	135	17.9	>35.7
	136	8.9	>35.7
	137	0.3	1.1

[0283]

表 8. MIC(mg/L)的许多苯硼酸半酯化合物用作挥发处理剂抵抗番茄灰霉病菌(*Botrytis cinerea*)和扩展青霉菌(*Penicillium expansum*)植物真菌病原体。

结构	化 合 物 编 号	MIC(mg/L)	
		BOTRCI	PENIEX
	202	35.7	142.9
	203	8.9	142.9
	204	8.9	>35.7

[0284] BOTRCI = 番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) (灰霉病)

[0285] PENIEX = 扩展青霉菌 (*Penicillium expansum*) (苹果蓝霉)

[0286] 实施例 10

[0287] 将 12- 孔 (6.5 每个孔的按 mL 计的体积) 微量滴定板用于挥发性抗微生物化合物的体外抑制试验 A 和 B(图 1) 抵抗许多植物真菌病原体。将 3-mL 体积的全强度的番茄葡萄糖琼脂 (PDA) 添加至每个孔。冷却之后, 将 1 μL 的 1×10<sup>5</sup> 孢子每 mL 的番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*), 扩展青霉菌 (*Penicillium expansum*), 烟草赤星病菌 (*Alternaria alternata*), 胶孢炭疽病菌 (*Glomerella cingulata*), 指状青霉菌 (*Penicillium digitatum*), 桃褐腐病菌 (*Monilinia fruticola*), 黑曲霉菌 (*Aspergillus brasiliensis*), 尖孢炭疽菌 (*Colletotrichum acutatum*), 接骨木镰刀菌 (*Fusarium sambucinum*), 辣椒疫霉菌 (*Phytophthora capsici*), 白地霉菌 (*Geotrichum candidum*), 黑曲霉菌 (*Aspergillus niger*), 棉色二孢菌 (*Diplodia gossypina*) 或柑桔砂皮病菌 (*Diaporthe citrii*) 悬浮液点滴在琼脂的中心上。将 Whatman#1 滤片 (Cat. No. 1001-0155) 一式两份放置在聚乙烯 PCR 板密封膜的下侧。为了确定最小抑菌浓度 (MIC), 将试验化合物在丙酮中稀释, 并且将适当量的化合物以剂量依赖的方式添加至所述片以实现最终的顶空浓度为 35.7 至 0.03mg/L。允许丙酮蒸发五分钟。将培菌液周围的顶空然后通过具有含杀

菌剂粘附片的膜通过将板倒放在经处理的片上密封在孔的内部，并且密封以防止任何化学品从片剥落并且落在经接种的琼脂上。在 23°C 储存 3 天之后，评价培养物相对于对照物的生长百分比。示于表 9 中的结果表明苯硼酸半酯化合物 A 和 B 通过挥发性活性控制生长许多真菌植物病原体的能力。

[0288]

表 9. MIC(mg/L) 的化合物 A 和 B 用作挥发性物质抵抗许多真菌植物病原体

病原体	化合物 A	化合物 B
	MIC	MIC
番茄灰霉病菌( <i>B. cinerea</i> )	2.2	4.5
扩展青霉菌( <i>P. expansum</i> )	1.1	8.9
桃褐腐病菌( <i>M. fruticola</i> )	2.2	1.1
烟草赤星病菌( <i>A. alternata</i> )	2.2	2.2
胶孢炭疽病菌( <i>G. cingulata</i> )	17.9	35.7
指状青霉菌( <i>P. digitatum</i> )	2.2	4.5
黑曲霉菌( <i>A. brasiliensis</i> )	2.2	0.6
尖孢炭疽菌( <i>C. acutatum</i> )	4.4	8.9
接骨木镰刀菌( <i>F. sambucinum</i> )	1.1	4.5
辣椒疫霉菌( <i>P. capsici</i> )	1.1	n/a
白地霉菌( <i>G. candidum</i> )	8.9	8.9

[0289]

白地霉菌( <i>A. niger</i> )	2.2	1.1
桃褐腐病菌( <i>M. piriformis</i> )	1.1	2.2
棉色二孢菌( <i>D. gossypina</i> )	1.1	4.5
柑桔砂皮病菌( <i>D. citri</i> )	2.2	17.9

## [0290] 实施例 11

[0291] 将 12- 孔 (6.5 每个孔的按 mL 计的体积) 微量滴定板用于挥发性抗微生物化合物的体外抑制试验 A(图 1) 抵抗许多细菌病原体。将 3-mL 体积的营养琼脂添加至每个池和在引入病原体中之前使得干燥。将大肠杆菌 (*Escherichia coli*), 胡萝卜软腐果胶杆菌 (*Pectobacterium carotovorum*), 柑桔溃疡病菌 (*Xanthomonas axonopodis*) 和肠道沙门氏菌 (*Salmonella enterica*) 的细胞悬浮液调节至光学密度为 0.2 至 0.35, 将其进一步稀释 1/10, 并且将 15  $\mu$ L 吸移至每个池的中心并且倾斜以均匀分布。将 Whatman#1 滤纸 (CAT 1001-0155) 放置在聚乙烯 PCR 板密封膜的下侧。为了确定最小杀菌浓度 (MBC), 将化合物 A 在丙酮中稀释, 并且将 50  $\mu$ L 一式两份, 以剂量依赖的方式施用至所述片, 以实现最终的顶空浓度为 71.4 至 0.03mg/L。允许丙酮挥发 5 分钟。将具有经处理的片的膜然后施用到接种板上并且密封。将板倒置, 并且在 23°C 接种 48 小时。在潜伏期之后, 将细菌菌落移入包含 tween 80 的无菌水 (0.001%) 中, 并且确定光学密度 (OD ;600nm)。结果汇总于表 10 中, 其中报告控制至少 80% 的细菌生长所需要的顶空浓度。在该体外测定中, 化合物 A 显示良好的抵抗许多细菌的抗微生物活性。

## [0292]

表 10. 提供抵抗细菌病原体的至少 80% 控制的化合物 A 的配额(mg/L)

大肠杆菌( <i>E. coli</i> )	胡萝卜软腐果胶杆菌( <i>P. carotovorum</i> )	柑桔溃疡病菌( <i>X. axonopodis</i> )	肠道沙门氏菌( <i>S. enterica</i> )
35.7	2.2	4.5	17.9

## [0293] 实施例 12

[0294] 为了评估挥发性抗微生物化合物 A 的体内活性, 开展挥发性生物测定以评价新鲜牛肉上的对照的大肠杆菌 (*Escherichia coli*) 和肠道沙门氏菌 (*Salmonella enterica*)。将牛肉洗涤通过在温水中漂洗 2 分钟以除去任何天然培菌液。将两个条单层放置在无菌 10.8- 杯 SnapWare 密封容器 (型号 #109842) 中。

## [0295]

表 11. 在用化合物 A 进行挥发处理之后，来自牛肉的大肠杆菌(*E. coli*)和肠道沙门氏菌(*S. enterica*)的菌落形成单位(CFU/mL)和 log 减少(log reductions)。

病原体	处理剂	Log CFU/mL	Log 减少
大肠杆菌( <i>E. coli</i> )	对照物	8.27	3.17
	化合物 A	5.09	
肠道沙门氏菌( <i>S. enterica</i> )	对照物	7.38	2.43
	化合物 A	4.95	

[0296] 将每个条通过放置 20  $\mu$ L 的调节至光学密度为 0.35 (600nm) 的大肠杆菌 (*E. coli*) 或肠道沙门氏菌 (*S. enterica*) 细胞悬浮液接种在表面上，并且进一步稀释 1/10。为了确定功效，将化合物 A 粉末以实现最终顶空浓度为 100mg/L 所需要的配额引入具有升华装置的容器中（将铜管在 0.5 升每分钟 (L/分钟) 的风机流量加热至 200°C）。将容器及其内容物然后在 21°C 培育 2 天。处理之后，将牛肉洗涤，并且将洗涤物收集，连续稀释，覆盖在营养琼脂上，然后在 37°C 培育另外 24 小时。将细菌菌落计数并且表示为菌落形成单位 (CFU/mL)，其中相对于对照物计算 log 减少。列于表 11 中的结果显示，在使用牛肉的该体内测定中，化合物 A 良好的抵抗大肠杆菌 (*E. coli*) 和肠道沙门氏菌 (*S. enterica*) 的抗微生物活性。化合物 A 表明大肠杆菌 (*E. coli*) 的 3.17log 减少 (>99.9%) 和肠道沙门氏菌 (*S. enterica*) 的 2-log 减少。

[0297] 实施例 13

[0298] 为了评估挥发性抗微生物化合物对于控制观赏花卉上番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 的体内活性 A，使用白色康乃馨开展挥发性生物测定。

[0299]

表 12. 用化合物 A 处理的康乃馨上番茄灰霉病菌(*Botrytis cinerea*)的发病率

化合物 A	花瓣上的发病率(%)				
	配额(mg/L)	0 天	1 天	2 天	3 天
1	0	0	0	4	16
0.2	0	8	20	16	36

[0300]

0.04	0	0	16	40	92
对照	0	68	92	96	100

[0301] 将五朵康乃馨放置在 800mL 的包含 200mL 常用商业花卉保鲜剂的罐中。将五个罐然后放置在 117L Rubbermaid 储存箱 (Cat#2244) 中。将花瓣用 5mL  $1 \times 10^5$  孢子 / mL 的番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 悬浮液均匀喷雾接种。将管密封。对于处理剂施用，将化合物 A 溶解在 1, 2-丙二醇水溶液 (3:1) 中，并且将 5mL 所述溶液使用 ES-100-H SmartFog 系统 (Reno, NV) 通过施用之后立即密封的”侧口挥发到容器中。将花在 21°C 培育 3 天。储

存之后，基于花瓣相对于未处理的对照花上在 21℃ 至多 8 天存在的病害评价花的发病率，结果汇总于表 12 中。在 1mg/L 的化合物 A 在处理剂除去之后显示 0% 发病率 2 天和在 8 天之后仅为 16% 的发病率，并且通常表明在该体内分析时观赏花卉中良好的抵抗番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 感染的挥发性抗微生物活性。

[0302] 实施例 14

[0303] 与上述试验类似的试验也在具有天然培菌液的白色康乃馨（用商业抗乙烯化合物硫代硫酸银；STS 处理或不用商业抗乙烯化合物硫代硫酸银；STS 处理）上进行。将化合物 A 溶解在 1, 2-丙二醇水溶液 (3:1) 中并且将 5mL 所述溶液使用 ES-100-H SmartFog 系统 (Reno, NV) 通过施用之后立即密封的”侧口挥发，或将化合物 A 溶解在丙酮中并且施用至 42.5 毫米 (mm) Whatman#1 滤片 (Cat. No. 1001-042)，并且在使得丙酮挥发 5 分钟之后将其放置在表面玻璃上。将花培育 3 天在 21℃。储存之后，基于花瓣和萼片上存在的病害数量评价花的另外 8 天的病害严重程度。列于表 13 中的结果显示在该体内分析中的良好的抵抗番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 的抗微生物活性。

[0304]

表 13. 基于用化合物 A 进行主动雾化或被动挥发处理之后的花瓣和萼片上的病害数量，8 天储存期之后的番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 的严重程度。

		严重程度(病害平均数量)			
化合物 A		非 STS		STS	
植物部分	配额(mg/L)	雾化	挥发	雾化	挥发
花瓣	1	0	1.5	0	0.1
	0.2	0	1.8	0	0.1

[0305]

	0.04	0.4	3.1	0.3	0.5
	0	2.1	18.8	7.7	43.2
萼片	1	0.04	1	0.04	0.2
	0.2	0.04	1.6	0.1	0.3
	0.04	0.3	2.1	0.6	1.1
	0	4.5	4.8	6.8	3.6

[0306] 实施例 15

[0307] 与上述试验类似的试验也在具有天然培菌液的白玫瑰上进行。将五朵白玫瑰放置在 800mL 的包含 200mL 常用的商业花卉保鲜剂的罐中。

[0308]

表 14. 基于在 21 °C 进行化合物 A 挥发处理三天和在 21 °C 另外两天之后白玫瑰花瓣和萼片上的感染，番茄灰霉病菌(*Botrytis cinerea*)的发病率和严重程度。

化合物 A	通过升华施用		从 Whatman 过滤器挥发	
配额(mg/L)	发病率(%)	严重程度(0-4)*	发病率(%)	严重程度(0-4)*
1	0	0	53.3	1.6
0.2	13.3	0.5	66.7	1.8
0.04	46.7	1.7	46.7	1.1
对照-丙酮	80	2.9	86.7	2.4
对照	100	3.1	100	3.1

\*严重程度等级

0 = 无病害
1 = 褐变和萼片或花瓣上的小病害
2 = 褐变，花瓣覆盖有真菌孢子
3 = 褐变，花瓣覆盖有真菌孢子，有些花瓣落下
4 = 褐变，花瓣覆盖有真菌孢子，有些花败落

[0309] 将三个罐然后放置在 117L Rubbermaid 储存箱 (Cat#2244) 中。将两个小的风机放置在容器的相对两端中以协助挥发性分布化合物 A。将管密封，然后将化合物 A 在丙酮中稀释，然后吸移至 1.5 英寸 × 1 英寸棉条上。使得丙酮挥发五分钟。将化合物 A 然后通过升华装置（将铜管在风机流量为 0.5L/分钟加热至 200 °C）引入至容器通过立即密封之后施用的 1/2”侧口以实现最终顶空浓度为 0.04, 0.2, 1mg/L。可选择地，将化合物 A 吸移至由表面玻璃支持的 42.5mm Whatman#1 滤片 (Cat. No. 1001-042) 上，其中在密封容器之前使得丙酮蒸发五分钟。将花在 21°C 培育三天。处理之后，评价另外两天花的发病率和花瓣的严重程度。施加在 1mg/L 通过升华的处理导致 0% 的发病率。用化合物 A 处理之后的玫瑰花瓣没有发病率，保留白颜色，并且玫瑰没有花瓣落下。列于表 14 中的结果显示白玫瑰良好的抵抗番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 感染的抗微生物活性，并且提高通过升华挥发的速率导致更明显的病害防治。

#### [0310] 实施例 16

[0311] 为了试验化合物 A (图 1) 在蔬菜上的效果，番茄、洋葱和笋瓜得自本地商店，并且表面用 0.825% 的次氯酸钠 (NaOCl) 消毒。将一片番茄或两叶洋葱放置在无菌 Petri 板中，同时整个笋瓜放置在无菌 10.8- 杯 SnapWare 密封容器 (型号 #109842) 中。将每片番茄用 20 μL 的 1×105 孢子 /mL 接骨木镰刀菌 (*Fusarium sambucinum*) 悬浮液接种，同时洋葱用 20 μL 的 1×106 孢子 /mL 番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 悬浮液接种。对于接种笋瓜，将小核除去，将辣椒疫霉菌 (*Phytophthora capsici*) 的菌丝插头插入并且在核心封端。将化合物 A 在丙酮中稀释，并且以实现最终的顶空浓度为 10mg/L 的配额添加至连接至盖内侧的 42.5mm Whatman#1 滤片 (Cat. No. 1001-042)。在石蜡膜 (parafilm) 密封所述板或关闭

密封容器之前使得丙酮蒸发 5 分钟。将蔬菜在 21°C 培育 3 天，并且评价菌丝体生长，干腐，和水浸泡的外观（以 mm 计的直径），结果汇总于表 13 中。在该体内测定时，化合物 A 表明使用 3 种不同的蔬菜作物对 3 种植物病原体良好的真菌防治。

[0312]

表 15. 化合物 A 在控制番茄，洋葱和笋瓜上真菌生长的效果					
	番茄		洋葱		笋瓜
	接骨木镰刀菌 ( <i>Fusarium sambucinum</i> )	番茄灰霉病菌 ( <i>Botrytis cinerea</i> )	辣椒疫霉菌 ( <i>Phytophthora capsici</i> )		
处理剂	菌丝体生长	干腐	水浸泡	水浸泡	菌丝体生长
10 mg/L	0	0	0	5.3	1.1
对照-丙酮	4.3	4.7	7	24	17.4
对照-没有丙酮	31.6	10.3	8.5	30.9	24.7

[0313] 实施例 17

[0314] 为了试验化合物 A 在控制蔬菜的细菌病原体的效果，将番茄，洋葱和胡萝卜切成小方块，表面用 0.825% NaOCl 消毒，并且使得干燥。将每种蔬菜的四个小方块（约 1 平方厘米 (cm<sup>2</sup>) 放置在无菌 Petri 板中。将每个方块用 25 μL 的胡萝卜软腐果胶杆菌 (*Pectobacterium carotovorum*) (细菌浓度为 OD 1.0, 600nm) 接种。为了确定功效，将化合物 A 在丙酮中稀释，并且将为实现最终顶空浓度为 50mg/L 的适当体积添加至与盖的内侧连接的 42.5mm Whatman#1 滤片 (Cat. No. 1001-042)。在关闭所述板并且将其用石蜡膜密封之前允许丙酮蒸发五分钟。将蔬菜在 10C 培育四天。列于表 16 中的结果表明在该体内分析时抵抗洋葱 (2.14log 减少)，胡萝卜 (0.29log 减少) 和番茄 (0.84log 减少) 上的胡萝卜软腐果胶杆菌 (*P. carotovorum*) 的抗微生物活性。

[0315]

表 16. 化合物 A(50 mg/L)减少番茄，洋葱和胡萝卜上的胡萝卜软腐果胶杆菌 ( <i>P. carotovorum</i> ) 生长的效果。			
Crops	处理剂	Log CFU/mL	Log 减少
番茄	对照物	7.47	
	化合物 A	6.63	0.84
洋葱	对照物	8.13	
	化合物 A	5.99	2.14
胡萝卜	对照物	6.36	
	化合物 A	6.06	0.29

[0316] 实施例 18

[0317] 为了评估挥发性抗微生物化合物在水果中的体内活性 A, 使用草莓, 葡萄和越橘开展挥发性生物测定。将八个草莓, 16 串葡萄或 30 个越橘 (一式两份) 放置在商业相关的涂胶的 PET 抓斗, 其中茎端朝向为越橘和葡萄, 和向下为草莓。将新鲜伤口用 20  $\mu\text{L}$  (草莓和葡萄) 或 10  $\mu\text{L}$  (越橘) 的 1×10<sup>6</sup> 每 mL 番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 孢子悬浮液接种。将抓斗放置在 10.8- 杯 SnapWare 密封容器 (型号 #109842) 内部。将 42.5mm Whatman#1 滤片 (Cat. No. 1001-042) 放置在表面玻璃上。将化合物 A 溶解在丙酮中并且以剂量依赖的方式添加至所述片以得到最终顶空浓度为 0.4, 2 或 10mg/L。允许丙酮蒸发五分钟。将容器然后用盖封闭并且在 21°C 放置三天。储存之后, 评价水果在 21°C 另外三天的发病率和严重程度 (0 至 4), 结果汇总于表 17 中。结果表明良好的对番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 的体内挥发性抗微生物控制, 其中在三天储存期之后对于草莓, 葡萄和越橘的约 50% 的较低发病率和显著降低的严重程度。

[0318]

表 17. 在 21 °C 在 3 天后处理评价期间, 化合物 A(0.4, 2 或 10 mg/L)进行三天挥发处理在控制草莓, 葡萄和越橘对于灰霉病菌 (*B. cinerea*) 感染的发病率和严重程度的效果。

化合物 A	评价	草莓		葡萄		越橘	
		发病率	严重程度	发病率	严重程度	发病率	严重程度
配额(mg/L)	天数	(%)	(0-4)	(%)	(0-4)	(%)	(0-4)
10	0	7.1	0	0	0	12.9	0.1
2	0	14.3	0.1	0	0	9.7	0
0.4	0	0	0	3.1	0	21	0.1
对照	0	50	0.4	100	2.3	95.2	1.2
10	1	35.7	0.2	0	0	12.9	0.1
2	1	50	0.3	0	0	9.7	0
0.4	1	21.4	0.1	3.1	0	21	0.2
对照	1	100	1	100	2.5	100	1.7
10	2	42.9	0.5	3.1	0	12.9	0.2
2	2	50	0.3	0	0	9.7	0.1
0.4	2	21.4	0.1	15.6	0.2	40.3	0.5
对照	2	100	2.2	100	2.7	100	1.9
10	3	42.9	0.8	56.3	0.4	41.9	0.6
2	3	64.3	0.5	56.3	0.3	40.3	0.6
0.4	3	28.6	0.5	62.5	0.5	62.9	1
对照	3	100	2.7	100	3.8	100	2.1

[0319] \* 严重程度

[0320] 0 = 没有真菌生长

- [0321] 1 = 轻微感染 (显微镜下仅为可见的内部伤口)
- [0322] 2 = 中度感染 (接种点上的可见到的生长)
- [0323] 3 = 高度感染 (>1cm 直径的葡萄孢属的视锥细胞)
- [0324] 4 = 极度感染 (> 半长的水果)
- [0325] 实施例 19
- [0326] 为了评估挥发性抗微生物化合物在水果中的体内活性 A, 使用柑橘类水果开展挥发性生物测定。将两个橙放置在 PET 抓斗内部。三个新鲜伤口每个橙用 30 μL 的 1×106 每 mL 指状青霉菌 (*Penicillium digitatum*) 孢子悬浮液接种。将抓斗放置在 10.8- 杯 SnapWare 密封容器 (型号 #109842) 内部。将 42.5mm Whatman#1 滤片 (Cat. No. 1001-042) 放置在表面玻璃上。将化合物 A 溶解在丙酮中并且以剂量依赖的方式添加至所述片以制得最终顶空浓度为 2, 10 或 50mg/L。允许丙酮蒸发五分钟。将容器然后用盖封闭并且在 21°C 放置三天。储存之后, 评价水果在 21°C 另外两天在所述水果表面上的发病率 (腐坏的按 mm 计的直径) 和病原菌产孢量 (按 mm 计的直径), 结果汇总于表 18 中。结果表明, 特别在大于 10mg/L 配额的良好的对在接种的橙内指状青霉菌 (*P. digitatum*) 的体内挥发性抗微生物控制。
- [0327]

表 18. 通过在所述水果表面上的水浸泡病害和真菌孢子描述的橙上的指状青霉菌 (*Penicillium digitatum*) 的发病率和严重程度

化合物 A 配额(mg/L)	水浸泡病害(mm)			产孢量(mm)		
	0 天	1 天	2 天	0 天	1 天	2 天
50	0	0	5	0	0	1.2
10	0	0	9	0.5	0.4	2.5
2	0	0	13.4	0	0.4	2.7
对照	17.8	31.2	52.4	5	15.1	35.6

- [0328] 实施例 20

- [0329] 为了评估挥发性抗微生物化合物在水果中的体内活性 A, 使用苹果开展挥发性生物测定。将两只苹果放置在 PET 抓斗内部。将三个新鲜伤口每个苹果用 30 μL 的 1×106 每 mL 扩展青霉菌 (*Penicillium expansum*) 孢子悬浮液接种。将抓斗放置在 10.8- 杯 SnapWare 密封容器 (型号 #109842) 内部。将 42.5mm Whatman#1 滤片 (Cat. No. 1001-042) 放置在表面玻璃上。将化合物 A 溶解在丙酮中并且以制得最终顶空浓度为 50mg/L 的方式添加至所述片。允许丙酮蒸发五分钟。将容器然后用盖封闭, 并且在 21°C 放置三天。储存之后, 评价水果在 21°C 另外三天在所述水果表面上的发病率 (腐坏的按 mm 计的直径) 和病原菌产孢量 (按 mm 计的直径), 结果汇总于表 19 中。结果表明, 在处理之后至多 3 天, 苹果 100% 的对指状青霉菌 (*P. digitatum*) 霉菌的体内挥发性抗微生物控制。

- [0330]

表 19.通过在所述水果表面上褐腐和真菌孢子描述苹果上扩展青霉菌(*Penicillium expansum*)的发病率和严重程度

化合物 A	腐坏(mm)				产孢量(mm)			
	0 天	1 天	2 天	3 天	0 天	1 天	2 天	3 天
50	0	0	0	0	0	0	0	0
对照	15.9	20.1	25.7	30	3.5	3.9	3.9	6.5

[0331] 实施例 21

[0332] 为了评估挥发性抗微生物化合物的体内活性 B 在水果中, 使用橙开展挥发性生物测定。将两个橙一式两份放置在抓斗内部。将三个新鲜伤口每个橙用 30  $\mu\text{L}$  的  $1 \times 10^6$  每 mL 指状青霉菌 (*Penicillium digitatum*) 孢子悬浮液接种。将抓斗放置在 10.8- 杯 SnapWare 密封容器 (型号 #109842) 内部。将化合物 B 粉末通过升华装置 (将铜管在风机流量为 0.5L/分钟加热至 200°C) 引入至容器以实现最终顶空浓度为 0.4, 2, 10 或 50mg/L。将容器然后用盖封闭并且在 21°C 放置三天。储存之后, 评价水果在 21°C 另外三天在所述水果表面上的发病率 (腐坏的按 mm 计的直径) 和病原菌产孢量 (按 mm 计的直径), 结果汇总于表 20 中。结果表明在配额为 0.4mg/L 良好的橙内指状青霉菌 (*P. digitatum*) 的体内挥发性抑制和在 10mg/L 的完全抑制。

[0333]

表 20.通过用化合物 B 处理之后在所述水果表面上的水浸泡病害和真菌孢子描述橙上的指状青霉菌(*Penicillium digitatum*)的发病率和严重程度。

化合物 B	水浸泡病害(mm)				产孢量(mm)			
	0 天	1 天	2 天	3 天	0 天	1 天	2 天	3 天
50	0	0	0	0	0	0	0	0
10	0	0	0	0.8	0	0	0	0
2	0.5	7.8	30.7	42.6	0	0.3	2.8	5.7
0.4	5.7	29.4	49.3	63.4	0.7	1.4	8.1	27.2
对照	12.3	35.5	61.1	83.2	0.3	2.7	8.5	44.5

[0334] 实施例 22

[0335] 为了评估水果中的挥发性抗微生物化合物的体内活性 A(图 1), 使用苹果, 梨, 橙, 草莓, 葡萄和越橘开展挥发性生物测定。将两只苹果, 2 个橙, 2 个梨, 8 个草莓, 16 串葡萄或 30 个越橘 (每复制份, 一式两份) 放置在抓斗中, 其中茎端朝向全部水果, 不同之处在于草莓 (茎端朝下)。将新鲜伤口用 20  $\mu\text{L}$   $1 \times 10^6$  每 mL 扩展青霉菌 (*Penicillium expansum*) 孢子悬浮液 (苹果和梨), 20  $\mu\text{L}$   $1 \times 10^6$  每 mL 指状青霉菌 (*Penicillium digitatum*) 孢子悬浮液 (橙), 和 20  $\mu\text{L}$  (草莓和葡萄) 或 10  $\mu\text{L}$  (越橘) 的  $1 \times 10^6$  每 mL 番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 孢子悬浮液接种。将抓斗放置在 117L 用盖封闭的 Rubbermaid 储存箱 (Cat#2244) 的内部。将溶解在丙酮中的化合物 A 吸移至棉条上, 其中使得丙酮蒸发五分钟, 然后通过升华装置 (将铜管在风机流量为 0.5L/分钟加热至 200°C) 引入容器中以实现最

终顶空浓度为 10mg/L。将容器然后在 21°C 保持三天。处理之后, 将水果在 21°C 保持另外三天, 然后评价对于苹果, 梨和橙的发病率 (褐变或水浸泡病害的按 mm 计的直径) 和病原菌产孢量 (按 mm 计的直径), 以及对于草莓, 葡萄和越橘的番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 发病率 (%) 和严重程度 (0 至 4), 结果汇总于表 21 中。结果表明当作为挥发性杀菌剂施用时良好的对至少六个不同宿主上至少三个真菌病原体的体内抗微生物控制。

[0336]

表 21: 升华化合物 A 的效果, 其通过以下反映: 通过在 21 °C 三天处理加上另外三天之后水浸泡病害, 褐变和产孢量描述草莓, 葡萄和越橘上番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 的发病率和严重程度, 以及橙, 苹果和梨上番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 的严重程度。

处理剂 (10 mg/L)	发病率(%)			严重程度(0-4)		
	草莓	越橘	葡萄	草莓	越橘	葡萄
化合物 A	18.8	5	26.7	0.09	0.03	0.1
对照	100	100	80	3.6	2.2	0.9
<hr/>						
水浸泡病害		褐变(mm)		产孢量(mm)		
化合物 A	橙	苹果	梨	苹果	橙	梨
对照	3.04	5.4	2.7	0	8.55	0
	50.5	11.5	23.3	4.8	33.2	15.5

[0337] 实施例 23

[0338] 为了比较化合物 A 当通过不同机制主动挥发时的能力, 进行使用草莓的体内测定。将八个草莓放置在抓斗中, 其中茎端朝下。将新鲜伤口用 20 μL 的 1×105 每 mL 番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 孢子悬浮液接种。将抓斗放置在 10.8- 杯 SnapWare 密封容器 (型号 #109842) 中并且用盖封闭。将化合物溶解在丙酮中并且通过 ES-100-H SmartFog 系统 (Reno, NV) 借助于可密封的 1/2 英寸侧口挥发。可选择地, 将溶解在丙酮中的化合物 A 吸移至棉条上, 其中使得丙酮蒸发五分钟, 然后通过升华装置 (将铜管在风机流量为 0.5L/分钟加热至 200°C) 引入容器中以实现最终顶空浓度为 10mg/L。将所述水果在 21°C 储存三天。处理三天之后, 将水果在 21°C 储存另外三天, 然后评价病害的发病率 (%) 和严重程度 (0 至 4)。结果汇总于表 22 中并且表明在该体内分析中良好的抵抗番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 的抗微生物活性, 表明化合物 A 为有效的挥发性抗微生物剂。

[0339]

表 22. 化合物 A 的不同挥发施用方法的效果，其通过在 21 °C 处理三天加上另外三天之后在草莓上番茄灰霉病菌(*Botrytis cinerea*)的发病率和严重程度反映。

处理	发病率(%)	严重程度(0 至 4)
雾化, 10 mg/L 化合物 A	6.3	0.03
雾化, 对照	62.5	1.6
升华, 10 mg/L 化合物 A	0.0	0.0
升华, 对照	100.0	3.7

[0340] 实施例 24

[0341] 使用体内试验以评价化合物 A 可从不同材料和对照真菌病原体挥发的能力。将八个草莓放置在抓斗中，其中茎端朝下。将新鲜伤口用 20 μL 的 1×106 每 mL 番茄灰霉病菌(*Botrytis cinerea*)孢子悬浮液接种。将抓斗然后放置在 10.8-杯 SnapWare 密封容器(型号 #109842)中。将化合物 A 溶解在丙酮中，然后在配额为 200 毫克每平方米 (mg/m<sup>2</sup>) 均匀喷雾至纤维素纸和 Tyvek® fabric 上。使得丙酮蒸发。同样将化合物 A 溶解在丙二醇中并且均匀喷雾至纤维素纸和 Tyvek® fabric 上。在这种情况下未曾蒸发。

[0342]

表 23. 不同膜和随后释放化合物 A 在 21 °C 的三天处理和另外两天储存之后草莓上番茄灰霉病菌(*Botrytis cinerea*)的发病率和严重程度上的效果。

配额(mg/L)	膜类型	发病率(%)	严重程度(0-4)
----------	-----	--------	-----------

[0343]

0.4	纤维素纸	37.5	0.8
2	纤维素纸	37.5	0.7
10	纤维素纸	12.5	0.2
0.4	Tyvek®	31.3	0.5
2	Tyvek®	6.3	0.1
10	Tyvek®	6.3	0.3
对照	没有膜	100	2.5

[0344] 将材料件切割成适当尺寸以供给最终顶空浓度为 0.4, 2 或 10mg/L。将容器封闭，并且在 21°C 放置三天。处理之后，将水果在 21°C 储存另外两天，然后评价病害的发病率(%) 和严重程度(0 至 4)，结果汇总于表 23 中。结果表明化合物 A 良好的抵抗番茄灰霉病菌(*Botrytis cinerea*)的体内抗微生物活性，其中在以剂量依赖方式的全部配额时的发病率和严重程度减少，并且挥发性化合物可从不同物质释放。

[0345] 实施例 25

[0346] 使用体内试验以评价化合物 A 至可从不同物质和对照真菌病原体挥发的能力。将八个草莓放置在抓斗中, 其中茎端朝下。将新鲜伤口用 20  $\mu\text{L}$  的 1×106 每 mL 番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 孢子悬浮液接种。将抓斗然后放置在 10.8- 杯 SnapWare 密封容器 (型号 #109842) 中。作为化合物 A 的基材, 使用放置在表面玻璃上的 42.5mm Whatman#1 滤片 (Cat. No. 1001-042) 或典型地用于包装草莓的 10 平方厘米 ( $\text{cm}^2$ ) 纸板件。将化合物溶解在丙酮中并且在以实现最终的顶空浓度为 0.4, 2 或 10mg/L 的配额吸移在所述片上或涂在纸板上。允许丙酮蒸发五分钟。将容器封闭, 并且在 21°C 放置三天。处理之后, 将水果在 21°C 储存另外两天, 然后评价病害的发病率 (%) 和严重程度 (0 至 4), 结果汇总于表 24 中。结果表明化合物 A 良好的抵抗番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 的体内抗微生物活性, 其中在以剂量依赖方式的全部配额时发病率和严重程度减少, 并且挥发性化合物可从不同材料释放。

[0347]

表 24. 不同膜和随后释放的化合物 A 在 21 °C 三天处理和另外两天储存之后草莓上番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 的发病率和严重程度的效果。

配额(mg/L)	材料类型	发病率(%)	严重程度(0-4)
10	纸板	25	0.2

[0348]

2	纸板	37.5	0.3
0.4	纸板	87.5	0.9
对照	纸板	93.8	2.7
10	滤纸	18.8	0.3
2	滤纸	37.5	0.6
0.4	滤纸	56.3	2.5
对照	滤纸	100	2.5

[0349] 实施例 26

[0350] 使用体外试验以评价化合物 A (图 1) 可从不同物质挥发和控制真菌生长的能力。

[0351]

表 25. 不同材料在挥发释放化合物 A 和随后体外抑制(MIC)番茄灰霉病菌(*Botrytis cinerea*)上的效果。

材料	MIC(mg/L)
聚乙烯	0.28
PTFE-涂布的玻璃纤维	0.56
玻璃纤维	0.56
纤维素	0.56
二氧化硅	0.56
芳族聚酰胺和玻璃纤维	0.56
乙烯基-涂布的聚酯	0.56
丙烯酸类-涂布的玻璃纤维	0.56
有机硅-涂布的玻璃纤维	0.56
PTFE	1.1
纸板	2.2
芳族聚酰胺	2.2

[0352] 将 PTFE- 涂布的 (8577K81), 玻璃纤维 (8816k1), 二氧化硅 (8799K3), 芳族聚酰胺和玻璃纤维 (8821K4), 乙烯基 - 涂布的聚酯 (8843K31), 丙烯酸类 - 涂布的玻璃纤维 (8838K2), 有机硅 - 涂布的玻璃纤维 (87815K1), 芳族聚酰胺 (McMaster-Carr, Santa Fe Springs, CA-1206T1), 聚乙烯 PCR 密封膜, 纤维素 (Whatman#1, Cat No. 1001-0155), 和纸板切割成 15mm 直径的片。将 12- 孔 (6.5 每个孔的按 mL 计的体积) 微量滴定板用于挥发性抗微生物化合物的体外抑制试验。将 3-mL 体积的全强度的番茄葡萄糖琼脂 (PDA) 添加至每个孔。冷却之后, 将 1  $\mu$ L 的 1  $\times$  105 每 mL 番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 孢子悬浮液点滴吸移至琼脂的中心。将板在挥发性杀菌剂处理之前立即接种。将各种材料一式两份放置在聚乙烯 PCR 板密封膜的下侧。为了确定最小抑菌浓度 (MIC), 将化合物在丙酮中稀释, 并且将适当量的化合物以实现最终顶空浓度为 35.7 至 0.03mg/L 的剂量依赖方式添加至材料。允许丙酮蒸发五分钟。将番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 培菌液周围的顶空然后通过具有含杀菌剂材料的粘附片的膜密封在孔的内部。将板倒放在经处理的片上并且密封以防止任何化学品从片剥落并且落在经接种的琼脂上。在 23°C 储存三天之后, 将培养物基于真菌菌落直径的量度评价相对于对照物的生长百分比。实验结果汇总于表 25 中。结果表明, 化合物 A 可从许多物质挥发以抑制在类似水平的对照物时番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 体外生长。

[0353] 实施例 27

[0354] 使用体内试验评价化合物 A 控制种子真菌生长的能力。

[0355]

表 26. 10 mg/L 化合物 A 顶空处理剂在控制谷物上的黑曲霉菌(*Aspergillus brasiliensis*)生长的效果。

谷物	PDA 上的真菌生长(mm)		
	化合物 A	对照-丙酮	对照-没有丙酮
大麦	0	12.8	21.7
玉米干物 (Corn Dry)	0	10.1	22.8
黍	0	7.2	19.1
稻	0	7.5	21.6
黑麦	0	8.4	21
小麦	0	8.1	22.4

[0356] 将包含玉米, 小麦, 稻, 黑麦, 黍和大麦的谷物用 0.825 % NaOCl 表面消毒 1 分钟并且用无菌蒸馏水漂洗三次。谷物通过将其浸泡在  $1 \times 10^6$  孢子 /mL of 黑曲霉菌 (*Aspergillus brasiliensis*) 悬浮液中 1 分钟接种。在五个种子平皿接种 (plating) 在包含 25mL PDA 的 Petri 板中之前, 将过量培菌液用无菌纸巾吸出 (blotted out)。为了确定功效, 将化合物 A 在丙酮中稀释并且以实现最终顶空浓度为 0.4, 2 或 10mg/L 的剂量依赖方式添加至与盖的内侧连接的 42.5mm Whatman#1 滤片 (Cat. No. 1001-042)。在将板封闭并且用石蜡膜密封之前, 允许丙酮蒸发五分钟。将板在 23°C 培育三天。储存之后, 评价谷物的菌丝菌落直径 (mm), 结果汇总于表 26 中。结果表明在该体内分析中 100% 的对黑曲霉菌 (*Aspergillus brasiliensis*) 的控制。

[0357] 实施例 28

[0358] 为了评价化合物 A 与 1- 甲基环丙烯 (1-MCP) 的组合处理, 对于白玫瑰进行体内实验。

[0359]

表 27: 在用 1-MCP 处理 24 小时随后在 21 °C 化合物 A 三天挥发处理和在 21 °C 另外五天之后, 基于白玫瑰花瓣和萼片上感染的番茄灰霉病菌(*Botrytis cinerea*) 的发病率和严重程度。

处理剂	发病率(%)	严重程度*(0-4)
对照	66.7	2.0
1-MCP	33.3	0.4
0.008 mg/L	20.0	0.2
0.04 mg/L	20.0	0.03
0.2 mg/L	0.0	0.0
0.008 mg/L + 1-MCP	6.7	0.9
0.04 mg/L + 1-MCP	0.0	0.0
0.2 mg/L + 1-MCP	0.0	0.0

\*严重程度等级

0 = 无病害

1 = 褐变和萼片或花瓣上的小病害

2 = 褐变, 花瓣覆盖有真菌孢子

3 = 褐变, 花瓣覆盖有真菌孢子, 有些花瓣落下

4 = 褐变, 花瓣覆盖有真菌孢子, 有些花败落

[0360] 将五朵白玫瑰放置在 800mL 包含 200mL 常用的商业花卉保鲜剂的罐中。将三个罐然后放置在 117L Rubbermaid 储存箱 (Cat#2244) 中。将两个小的风机放置在容器的相对两端中以协助分布两个挥发分。将 500 份每十亿份 (ppb) 体积每体积 (v/v) 1-MCP 处理在 21 °C 施用 (AgroFresh, Springhouse, PA) 24 小时。1-MCP 处理完成之后, 将容器排气, 并且将化合物 A 粉末用升华装置 (将铜管在风机流量为 0.5L/分钟加热至 200 °C) 以实现最终顶空浓度为 0.2, 0.04 或 0.008mg/L 的剂量依赖方式施用, 其中管端渗透通过在施用之后立即密封的容器中的 1/2 英寸侧口。将花在 21 °C 培育三天。处理之后, 评价花在 21 °C 另外七天的花瓣的发病率和严重程度。列于表 27 中的结果显示白玫瑰良好的抵抗番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 感染的抗微生物活性, 并且提高通过升华挥发的速率导致更明显的病害防治。另外, 1-MCP 处理显示减少花瓣落下, 其通过严重程度评分反映。

[0361] 实施例 29

[0362] 为了评价化合物 A 与 1- 甲基环丙烯 (1-MCP) 的组合处理, 对于绿菜花进行体内实验。

[0363]

表 28. 在 10 或 21 °C 五天或三天处理和在 21 °C 另外两天，化合物 A 和 1-MCP 分别在控制绿菜花的链格孢属(*Alternaria*)腐坏和泛黄的效果

处理剂(mg/L)	21 °C		11 °C	
	严重程度	颜色评分*	严重程度	颜色评分*
对照	1.5	2.39	0.18	1.55
1-MCP	0.61	1.79	0.18	1.50
0.4 mg/L	0.29	1.32	0.00	1.75
2 mg/L	0.07	1.89	0.00	2.11
0.4 mg/L + 1-MCP	0.21	0.93	0.00	1.39
2 mg/L + 1-MCP	0.07	1.93	0.00	2.23

[0364] 颜色评分等级

[0365] 0 = 绿色, 正常看到的绿菜花

[0366] 1 = 少量的浅绿色斑

[0367] 2 = 浅绿色和黄色斑

[0368] 3 = 浅绿色, 黄色和一些褐色

[0369] 4 = 大多数黄色和褐色

[0370] 将绿菜花用 1×106 孢子 /mL 的烟草赤星病菌 (*Alternaria alternata*) 接种然后放置在 117L Rubbermaid 储存箱 (Cat#2244) 中, 其中两个小的风机放置在容器的相对两端中。将 500ppb v/v 1-MCP 处理 (AgroFresh, Springhouse, PA) 在 1°C 施用 24 小时。1-MCP 处理完成之后, 将绿菜花的小花移除并且放置在 10.8- 杯 SnapWare 密封容器 (型号 #109842) 中。将化合物 A 粉末用升华装置 (将铜管在风机流量为 0.5L/ 分钟加热至 200°C) 以实现最终顶空浓度为 2 或 0.4mg/L 的剂量依赖方式施用, 其中管端渗透通过施用之后立即密封的容器中的 1/2 英寸侧口。将小花在 10°C 培育五天或在 21°C 三天, 然后评价在 21°C 另外五天的发病率和严重程度。列于表 28 中的结果显示良好的抵抗烟草赤星病菌 (*Alternaria alternata*) 感染的抗微生物活性。

[0371] 实施例 30

[0372] 为了评价化合物 A 与 1- 甲基环丙烯 (1-MCP) 的组合处理, 对于番茄进行体内实验。将每个番茄果实受创伤三次并且用 1×106 孢子 /mL 的烟草赤星病菌 (*Alternaria alternata*) 接种, 然后放置在 117L Rubbermaid 储存箱 (Cat#2244) 中, 其中两个小的风机放置在容器的相对两端中。将 1000ppb v/v 1-MCP 处理 (AgroFresh, Springhouse, PA) 在 21°C 施用 24 小时。完成 1-MCP 处理之后, 将番茄除并且放置在 10.8- 杯 SnapWare 密封容器 (型号 #109842) 中。将化合物 A 粉末用升华装置 (将铜管在风机流量为 0.5L/ 分钟加热至 200°C) 以实现最终顶空浓度为 2 或 0.4mg/L 的剂量依赖方式施用, 其中管端渗透通过施用之后立即密封的容器中的 1/2 英寸侧口。将番茄在 21°C 培育三天, 然后评价在 21°C 另外三天的发病率和严重程度。列于表 29 中的结果显示番茄良好的抵抗烟草赤星病菌 (*Alternaria alternata*) 感染的活性。

[0373]

表 29: 在 21 °C 三天处理和在 21 °C 另外三天, 化合物 A 和 1-MCP 在控制番茄上链格孢属(*Alternaria*)腐坏的效果。

化合物 A	腐坏的直径(mm)
对照	14.8
1-MCP	13.6
0.4 mg/L	3.8
2 mg/L	0.0
0.4 mg/L + 1-MCP	3.8
2 mg/L + 1-MCP	0.0

[0374] 实施例 31

[0375] 为了评估水果中的挥发性抗微生物化合物的体内活性 A 和 B(图 1), 使用苹果, 梨, 橙, 草莓, 葡萄和越橘开展挥发性生物测定。

[0376]

表30.升华化合物A和B的效果, 其通过草莓, 葡萄和越橘上灰葡萄孢菌(*Botrytis cinerea*)的发病率和严重程度, 以及橙, 苹果和梨上的严重程度反映, 通过在21 °C三天处理加上另外三天之后的水浸泡病害, 褐变和产孢量描述。

[0377]

处理剂 (1 mg/L)	发病率(%)			严重程度(0-4)		
	草莓	越橘	葡萄	草莓	越橘	葡萄
化合物 A	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0
化合物 B	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0
对照	100.0	100.0	100.0	3.9	2.5	1.9

	水浸泡病害			产孢量(mm)		
	橙	苹果	梨	苹果	橙	梨
化合物 A	0.0	0.8	4.7	0.0	0.0	0.0
化合物 B	0.0	2.3	1.1	0.2	0.0	0.0
对照	73.2	21.7	29.7	46.0	5.2	18.5

[0378] 将两只苹果, 2 个橙, 2 个梨, 8 个草莓, 16 串葡萄或 30 个越橘 (每复制份, 一式两份) 放置在抓斗中, 其中茎端朝向全部水果, 不同之处在于草莓 (茎端朝下)。将新鲜伤口用 20 μL 1×106 每 mL 扩展青霉菌 (*Penicillium expansum*) 孢子悬浮液 (苹果和梨), 20 μL 1×106 每 mL 指状青霉菌 (*Penicillium digitatum*) 孢子悬浮液 (橙), 和 20 μL (草莓和葡萄) 或 10 μL (越橘) 的 1×106 每 mL 番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 孢子悬浮液接种。

将抓斗放置在 117L 用盖封闭的 Rubbermaid 储存箱 (Cat#2244) 内部。将化合物 A 和 B 粉末通过升华装置（将铜管在风机流量为 0.5L/分钟加热至 200°C）引入至容器以实现最终顶空浓度为 1mg/L。将容器然后在 21°C 保持三天。处理之后，将水果在 21°C 保持另外三天，然后评价苹果，梨和橙的发病率（褐变或水浸泡病害的按 mm 计的直径）和病原菌产孢量（按 mm 计的直径），以及草莓，葡萄和越橘的番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 的发病率（%）和严重程度（0 至 4），结果汇总于表 30 中。结果表明当作为挥发性杀菌剂施用时，通过化合物 A 和 B 两者在不同宿主上番茄灰霉病菌 (*B. cinerea*) 和指状青霉菌 (*P. digitatum*) 的 100% 体内抗微生物控制。

[0379] 实施例 32

[0380] 为了评估化合物 A 作为直接杀菌剂的活性，开展体外试验。使用 6cm- 直径的 Petri 板。将化合物 A 改为全强度的番茄葡萄糖琼脂 (PDA) 以实现最终溶液浓度为 10, 2, 0.4 或 0.08mg/L，并且将 15-mL 体积的溶液添加至每个板。冷却之后，将 1 μL 的 1×105 每 mL 扩展青霉菌 (*Penicillium expansum*) 或指状青霉菌 (*Penicillium digitatum*) 孢子悬浮液点滴吸移至琼脂的中心中。

[0381] 将板用石蜡膜密封并且放置在保持在 23°C 的培养箱中。储存三天之后，将培养物基于真菌菌落直径的量度评价相对于对照物的生长百分比。实验结果汇总于表 31 中。结果表明化合物 A 具有作为直接杀菌剂在该体外试验内抵抗植物真菌病原体的活性。

[0382]

表 31. 化合物 A 作为直接杀菌剂用于扩展青霉菌 (*Penicillium expansum*) 和指状青霉菌 (*Penicillium digitatum*) 的菌丝体生长抑制的体外 MIC。

病原体	发病率(%)	
	扩展青霉菌( <i>P. expansum</i> )	指状青霉菌( <i>P. digitatum</i> )
配额(mg/L)		
10	0.0	0.0
2	0.0	0.0
0.4	33.0	12.5
0.08	93.1	42.0

[0383] 实施例 33

[0384] 为了评估化合物 A (图 1) 作为接触淋湿杀菌剂的活性，开展体内试验。将两个苹果或 2 个橙（每复制份，一式两份）放置在抓斗中，并且制造在每个水果赤道区域附近的三个新鲜伤口。将化合物 A 溶解在水中以实现最终处理剂溶液浓度为 250, 50 或 10mg/L。将所述水果浸入化合物 A 溶液中 1 分钟并且使得干燥 1 小时。将水果伤口然后用 30 μL 的 1×106 每 mL 扩展青霉菌 (*Penicillium expansum*) 孢子悬浮液（苹果）或指状青霉菌 (*Penicillium digitatum*) 孢子悬浮液（橙）接种。将抓斗然后放置在 10.8- 杯 SnapWare 密封容器（型号 #109842）中并且在 21°C 培育 3 天。处理之后，将所述水果在 21°C 保持另外 3 天然后评价发病率（褐变或水浸泡病害的按 mm 计的直径）和病原菌产孢量（按 mm 计

的直径),结果汇总于表 32 中。结果表明当作为直接杀菌剂施用时良好的对 2 个不同宿主上 2 个真菌病原体的体内抗微生物控制。

[0385]

表 32. 化合物 A 作为直接杀菌剂分别用于控制橙和苹果上的指状青霉菌(*Penicillium digitatum*)和扩展青霉菌(*Penicillium expansum*)的体内 MIC。

[0386]

化合物 A(mg/L)	橙		苹果	
	水浸泡(mm)	产孢量(mm)	褐变(mm)	产孢量(mm)
对照	42.7	31.0	9.7	3.5
10	27.5	16.6	8.5	2.1
50	18.8	12.0	3.7	1.6
250	1.7	0.4	0.8	0.5

[0387] 实施例 34

[0388] 为了评估化合物 A 作为挥发性杀菌剂的活性,开展体外试验以评价孢子萌发。将 2mL 的水琼脂倾入 3.5cm Petri 板中。将化合物 A 溶解在丙酮中以实现最终处理剂溶液浓度为 0.14, 0.07 或 0.035mg/L。将板用 1 μL 1×106 每 mL 番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 和扩展青霉菌 (*Penicillium expansum*) 孢子悬浮液接种。将板然后在 0°C 培育一天, 在 0°C 五天或在 0°C 五天加上在 21°C 另外一天或两天。在每个时间点, 将板移除并且计数 100 孢子的萌发率 (percent germination), 其中将萌发定义为已经延长大于孢子长度的距离的萌发管 (germ tube)。结果汇总于表 33 中。在全部的三个处理浓度和温度的情况下, 化合物 A 完全 ly 抑制 the germination of 真菌病原体孢子试验的。

[0389]

表 33. 在 4 种不同温度的情况下用化合物 A 挥发处理所响应的番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 和扩展青霉菌 (*Penicillium expansum*) 孢子的萌发率

病原体	化合物 A 配额(mg/L)	萌发抑制(%)			
		5 天, 0 °C		5 天, 0 °C	21 °C
		1 天, 0 °C	5 天, 0 °C	1 天, 21 °C	2 天, 21 °C
番茄灰霉病 菌 ( <i>B.</i> <i>cinerea</i> )	0.14	0.0	0.0	0.0	0.0
	0.07	0.0	0.0	0.0	0.0
	0.035	0.0	0.0	0.0	0.0
	对照	44.8	98.7	92.2	98.4
	丙酮	48.9	98.9	93.9	95.8
扩展青霉菌 ( <i>P.</i> <i>expansum</i> )	0.14	0.0	0.0	0.0	0.0
	0.07	0.0	0.0	0.0	0.0
	0.035	0.0	0.0	0.0	0.0
	对照	0.0	1.1	12.6	30.8
	丙酮	0.0	0.0	6.4	21.8
[0390]					
[0391]	实施例 35				
[0392]	为了评估化合物 A 作为挥发性杀菌剂的活性, 开展体外试验以评价孢子萌发。将 3.5-cm Petri 板用 2mL 的水琼脂填充。冷却之后, 将 1 μL 的 1×105 每 mL 番茄灰霉病菌 ( <i>Botrytis cinerea</i> ) 孢子悬浮液点滴吸移至所述板的中心中。将板在挥发性杀菌剂处理之前立即接种。将 Whatman#1 滤片 (Cat. No. 1001-0155) 一式两份放置在板盖的下侧。为了确定最小抑菌浓度 (MIC), 将化合物在丙酮中稀释, 并且将适当量的化合物以剂量依赖的方式添加至所述片以实现最终的顶空浓度为 142.9 至 0.07mg/L。允许丙酮蒸发五分钟, 然后将所述盖放置在板上并且用石蜡膜密封。在 23°C 储存 24 小时之后, 计数 100 个孢子的萌发率, 其中将萌发定义为已经延长大于孢子长度的距离的萌发管。计数之后, 将处理剂移除, 并且将板再密封。另外 24 小时之后, 将 100 个孢子再计数。将插头然后转移至包含全强度的 PDA 的清洁板并且使得在 23°C 培育另外三天。接种之后, 确定菌丝体生长 (按 mm 计的直径) 并且汇总于表 34 中。24 小时之后, 在该挥发性体外测定中 100% 的对照孢子萌发, 而所有配额的化合物 A 导致 100% 的萌发抑制。这些结果显示, 化合物 A 提供杀菌效果, 与抑菌效果相反, 使得经处理的孢子甚至在化合物已经移除之后也不能萌发和生长为菌丝体。				
[0393]					

表 34. 化合物 A 挥发处理所响应的在转移至番茄灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 新鲜介质之后的孢子萌发和随后的菌丝体生长。

化合物 A	孢子萌发(%)		转移之后的菌丝体生长(%)
配额(mg/L)	24 h <sup>a</sup>	24 h + 24 h <sup>b</sup>	3 d <sup>c</sup>
对照	100.0	100.0	100.0
丙酮	98.4	92.7	100.0
142.9	0.0	0.0	0.0
71.4	0.0	0.0	0.0
35.7	0.0	0.0	0.0
17.9	0.0	0.0	0.0

[0394]

8.9	0.0	0.0	0.0
4.5	0.0	0.0	10.1
2.2	0.0	0.0	16.9
1.1	0.0	0.0	32.6
0.56	0.0	0.0	43.3
0.28	0.0	0.0	51.3
0.14	0.0	0.0	53.8
0.07	0.0	10.0	60.3

[0395] <sup>a</sup>24 小时处理剂之后确定的孢子萌发

[0396] <sup>b</sup>在处理剂移除之后的另外 24 小时之后确定的孢子萌发

[0397] <sup>c</sup>将培菌液转移至清洁 PDA 板之后的 3 天的菌丝体生长百分比

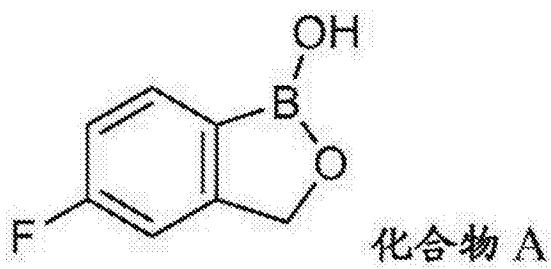


图 1

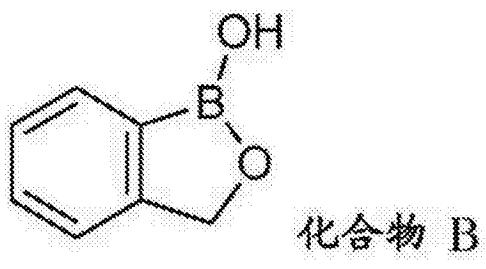


图 2

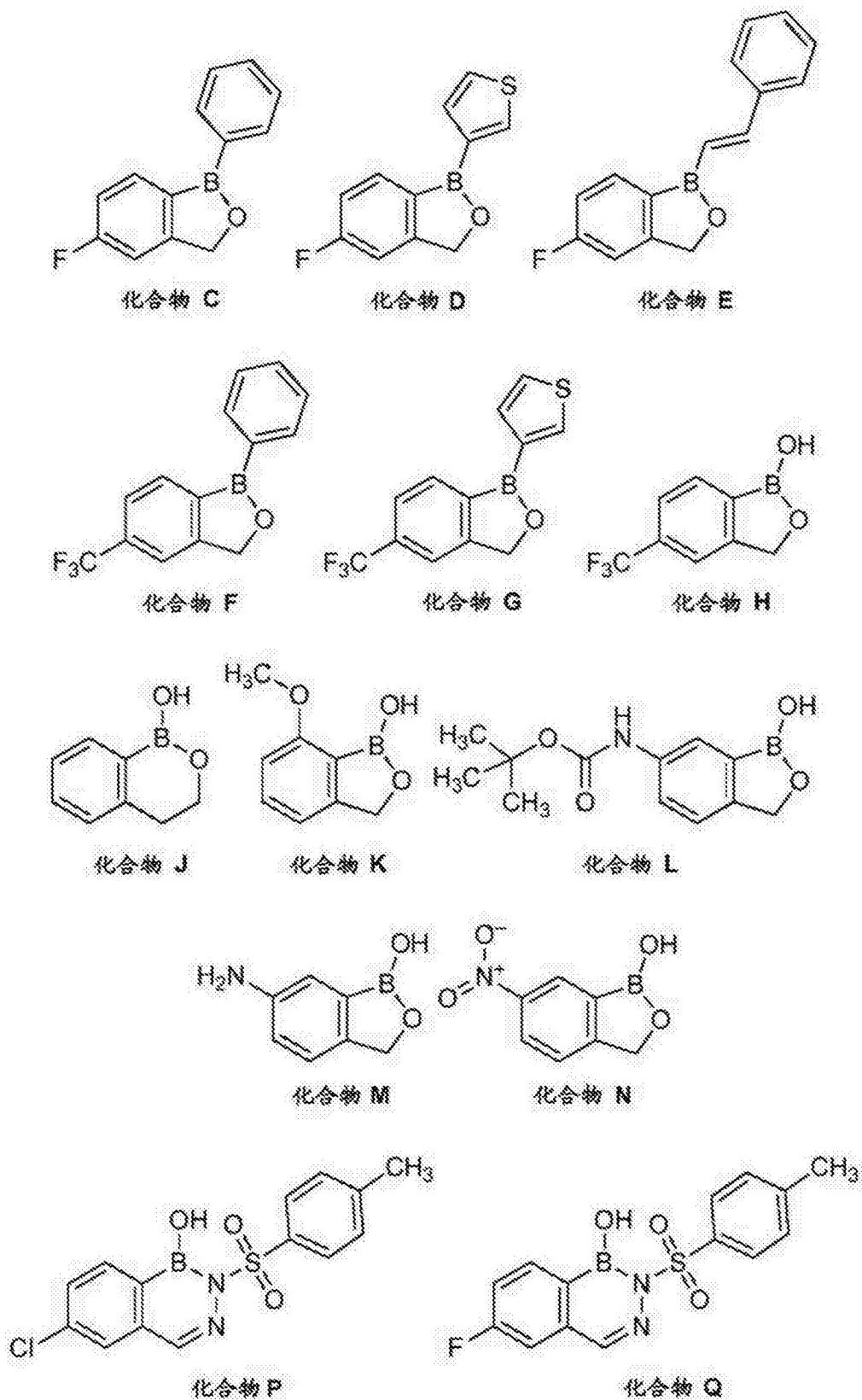


图 3

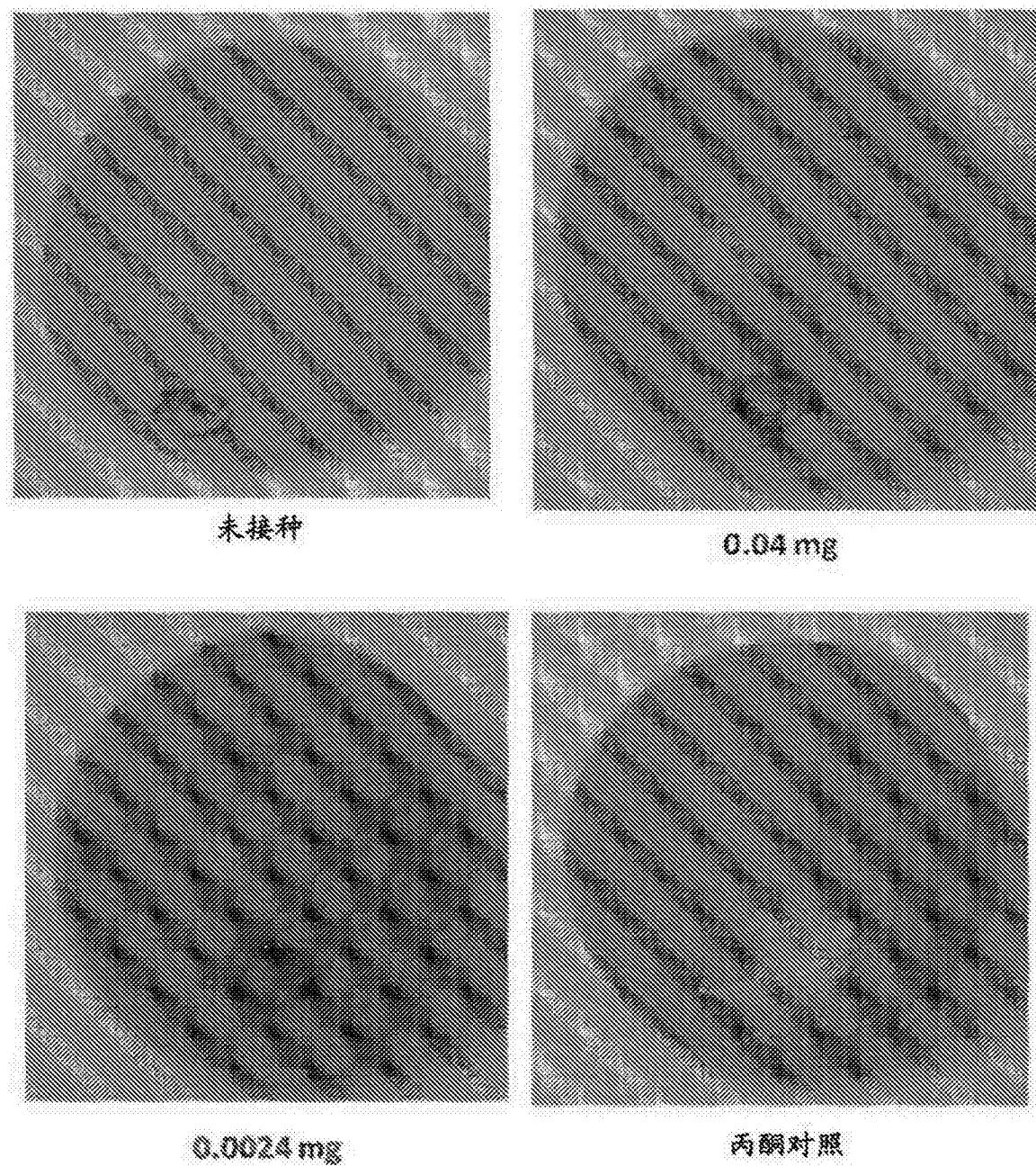
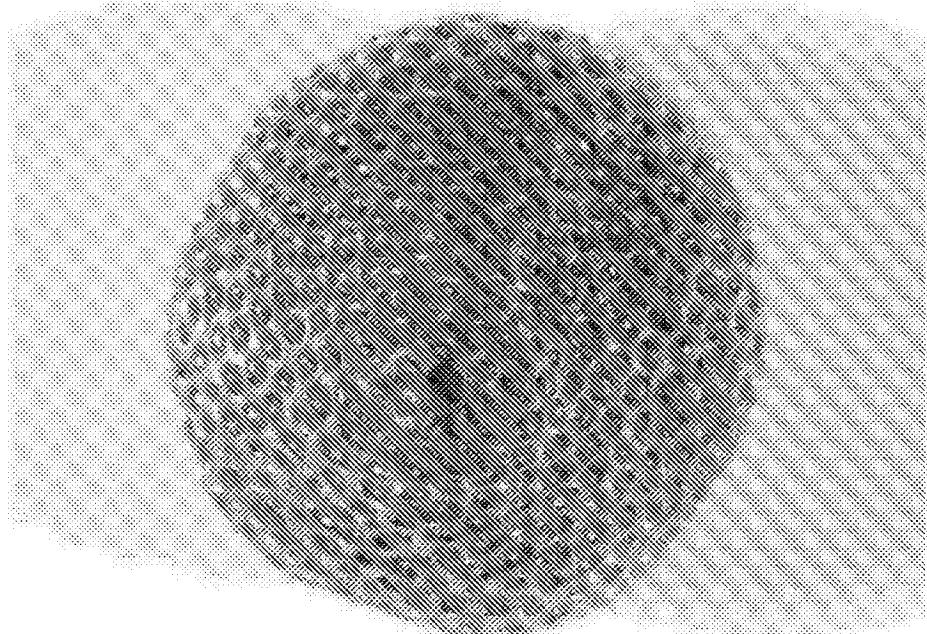
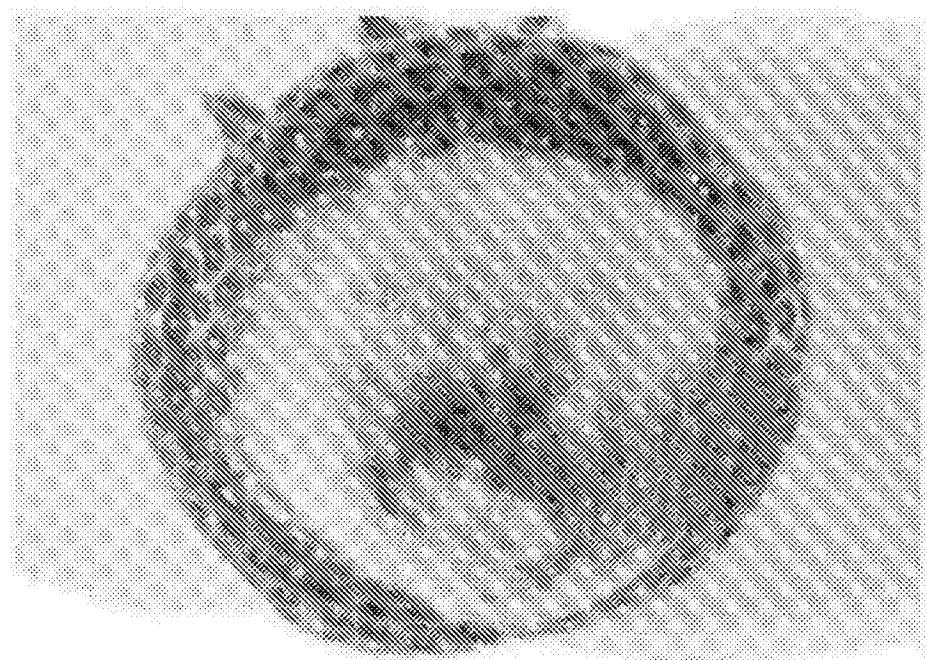


图 4



0.125 mg 化合物 A (苯硼酸半酯)

图 5A



0 mg (丙酮)

图 5B