



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 103172570 B

(45) 授权公告日 2015. 09. 30

(21) 申请号 201310041976. 9

C07D 409/12(2006. 01)

(22) 申请日 2008. 07. 31

C07D 403/12(2006. 01)

(30) 优先权数据

A01N 43/56(2006. 01)

07356105. 2 2007. 07. 31 EP

A01N 43/36(2006. 01)

08356061. 5 2008. 04. 16 EP

A01N 43/08(2006. 01)

A01N 43/10(2006. 01)

(62) 分案原申请数据

A01N 43/42(2006. 01)

200880101329. X 2008. 07. 31

A01P 3/00(2006. 01)

(73) 专利权人 拜尔农科股份公司

(56) 对比文件

地址 德国蒙海姆

WO 2006120224 A1, 2006. 11. 16, 说明书第 1 页第 31 行 - 第 2 页第 29 行、第 14 页第 28-30 行、第 19 页第 3-6 行.

(72) 发明人 P·德博尔德 S·加里

M·-C·格罗让-库尔诺瓦耶

B·哈特曼 P·黑诺尔费 A·特奇

J·-P·沃尔斯

CN 101772486 B, 2013. 03. 20, 权利要求 1-6.

WO 2008065500 A2, 2008. 06. 05, 实施例 129.

(74) 专利代理机构 上海专利商标事务所有限公
司 31100

WO 2007087906 A1, 2007. 08. 09, 权利要求 1、实施例 37、40、78、81、111、114、141、145、188、191、304-306、313、316、319、344、347.

代理人 陈哲锋

Itaru Okada 等. 吡唑-5-羧酰胺衍生物的合成和杀螨活性. 《农药译丛》. 1993, 第 15 卷 (第 3 期), 第 32-37 页.

黄青春. 羧酰胺类杀菌剂的活性及其机理研究进展. 《世界农药》. 2004, 第 26 卷 (第 4 期), 第 23-27 页.

(51) Int. Cl.

C07D 231/16(2006. 01)

C07D 231/14(2006. 01)

C07D 231/20(2006. 01)

C07D 207/34(2006. 01)

C07D 307/68(2006. 01)

C07D 333/38(2006. 01)

C07D 207/416(2006. 01)

C07D 401/12(2006. 01)

C07D 405/12(2006. 01)

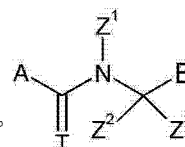
审查员 辜艳

权利要求书5页 说明书49页

(54) 发明名称

杀真菌剂 N-6 元稠合 (杂) 芳基 - 亚甲基 -N- 环烷基羧酰胺衍生物

病性真菌 (尤其是植物的) 的方法。

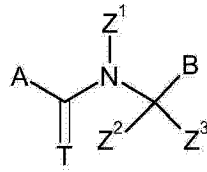


(I)

(57) 摘要

本发明涉及式(I)的 N-(芳香族 6 元稠合 (杂) 芳基 - 亚甲基) -N- 环烷基羧酰胺衍生物、其硫代羧酰胺或 N- 取代甲脒同系物, 式中 A 表示碳连接的 5 元杂环基; T 表示 O、S、N-R^c、N-OR^d、N-NR^cR^d 或 N-CN; Z¹ 到 Z³ 和 B 表示芳香族 6 元稠合 (杂) 芳基; 涉及它们的制备方法、它们作为杀杂菌剂活性剂的应用, 特别是以杀菌剂组合物的形式; 还涉及使用这些化合物或组合物防控植物致

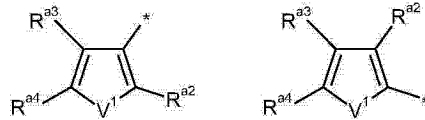
1. 一种式 (I) 的化合物及其盐：



(I)

式中：

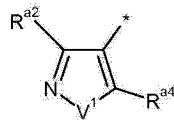
• A 表示：



A¹ 或 A²

其中 V¹表示 O、S 或 NR^{a1}，或者

A 表示：



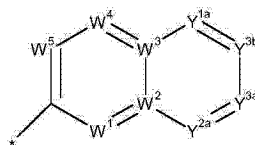
A⁵

其中 V¹表示 NR^{a1}；

• R^{a1}表示 C₁-C₈烷基；

• R^{a2}-R^{a4}独立地表示氢原子、卤原子、C₁-C₈烷基；包含最多 9 个可以相同或不同的卤原子的 C₁-C₈卤代烷基；或者 C₁-C₈烷氧基；

• B 表示



B¹

式中：

○ W¹-W⁵、Y^{1a}、Y^{2a}、Y^{3a}和 Y^{3b}表示 CR^{b3}；

○ 条件是 W²和 W³是 C

• T 表示 O 或 S；

• Z¹表示 C₁-C₈烷基取代的 C₃-C₇环烷基；

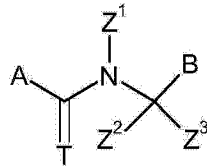
• Z²表示氢原子、C₁-C₈烷基或 C₁-C₈烷氧基羰基；

• Z³表示氢原子；

• R^{b3}表示氢原子；卤素原子；硝基；C₁-C₈-烷基；包含最多 9 个可以相同或不同的卤素原子的 C₁-C₈-卤代烷基；C₁-C₈-烷基氨基；C₁-C₈-烷氧基；

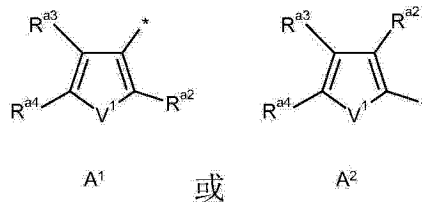
条件是式 (I) 的化合物不同于 N-环丙基-N-((6,8-二甲基-2-氧-1,2-二氢喹啉-3-基)甲基)-咪喃-2-羧酰胺、N-环丙基-N-((6-乙氧基-2-氧-1,2-二氢喹啉-3-基)甲基)-咪喃-2-羧酰胺和 N-环丙基-N-((6-甲基-2-氧-1,2-二氢喹啉-3-基)甲基)-咪喃-2-羧酰胺。

2. 一种式 (I) 的化合物及其盐：



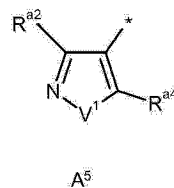
式中：

• A 表示：



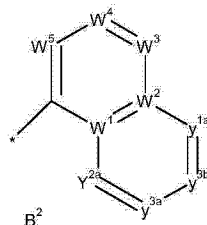
其中 V¹ 表示 O、S 或 NR^{a1}，或者

A 表示：



其中 V¹ 表示 NR^{a1}；

- R^{a1} 表示 C₁-C₈ 烷基；
- R^{a2}-R^{a4} 独立地表示氢原子、卤原子、C₁-C₈ 烷基；包含最多 9 个可以相同或不同的卤原子的 C₁-C₈ 卤代烷基；或者 C₁-C₈ 烷氧基；
- B 表示



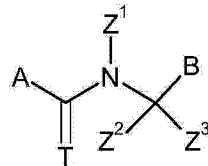
式中：

- W⁵ 表示 N, W¹-W⁴, Y^{1a}, Y^{2a}, Y^{3a} 和 Y^{3b} 表示 CR^{b3}；或
- W³ 表示 N, W¹-W², W⁴-W⁵, Y^{1a}, Y^{2a}, Y^{3a} 和 Y^{3b} 表示 CR^{b3}；或
- Y^{2a} 表示 N, W¹-W⁵, Y^{1a}, Y^{3a} 和 Y^{3b} 表示 CR^{b3}；或
- Y^{1a} 表示 N, W¹-W⁵, Y^{2a}, Y^{3a} 和 Y^{3b} 表示 CR^{b3}；或

- Y^{3b} 表示 N, W^1-W^5 、 Y^{1a} 、 Y^{3a} 和 Y^{2a} 表示 CR^{b3} ;或
- W^1-W^5 、 Y^{1a} 、 Y^{2a} 、 Y^{3a} 和 Y^{3b} 表示 CR^{b3} ;
- 条件是 W^1 和 W^2 是 C
- T 表示 O 或 S;
- Z^1 表示 C_1-C_8 烷基取代的 C_3-C_7 环烷基;
- Z^2 表示氢原子、 C_1-C_8 烷基或 C_1-C_8 烷氧基羰基;
- Z^3 表示氢原子;
- R^{b3} 表示氢原子;卤素原子;硝基; C_1-C_8 -烷基;包含最多 9 个可以相同或不同的卤素原子的 C_1-C_8 -卤代烷基; C_1-C_8 -烷基氨基; C_1-C_8 -烷氧基;
- R^{b2} 表示 C_1-C_8 -烷基;

条件是式 (I) 的化合物不同于 N-环丙基-N-((7,8-二氟-2-氧-1,2-二氢喹啉-4-基)甲基)-4-甲基噻唑-5-羧酰胺和 N-环丙基-N-((8-氟-2-氧-1,2-二氢喹啉-4-基)甲基)-4-甲基噻唑-5-羧酰胺。

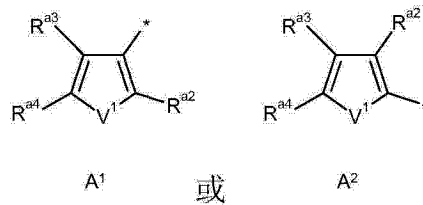
3. 一种式 (I) 的化合物及其盐:



(I)

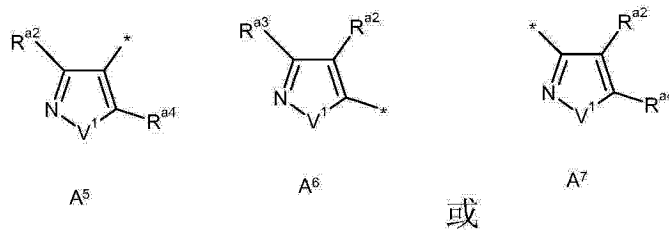
式中:

• A 表示:



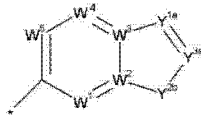
其中 V^1 表示 O、S 或 NR^{a1} , 或者

A 表示:



其中 V^1 表示 NR^{a1} ;

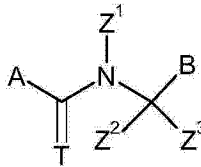
- R^{a1} 表示 C_1-C_8 烷基;
- $R^{a2}-R^{a4}$ 独立地表示氢原子、卤原子、 C_1-C_8 烷基;包含最多 9 个可以相同或不同的卤原子的 C_1-C_8 卤代烷基;或者 C_1-C_8 烷氧基;
- B 表示:



B³

- W¹-W⁵, Y^{1a}和 Y^{3a}独立地表示 CR^{b3}, 条件是 W²和 W³都表示 C ;
- Y^{2b}表示 NR^{b2};
- T 表示 O 或 S ;
- Z¹表示 C₁-C₈烷基取代的 C₃-C₇环烷基 ;
- Z²表示氢原子、C₁-C₈烷基或 C₁-C₈烷氧基羰基 ;
- Z³表示氢原子 ;
- R^{b3}表示氢原子 ; 卤素原子 ; 硝基 ; C₁-C₈- 烷基 ; 包含最多 9 个可以相同或不同的卤素原子的 C₁-C₈- 卤代烷基 ; C₁-C₈- 烷基氨基 ; C₁-C₈- 烷氧基 ;
- R^{b2}表示 C₁-C₈- 烷基。

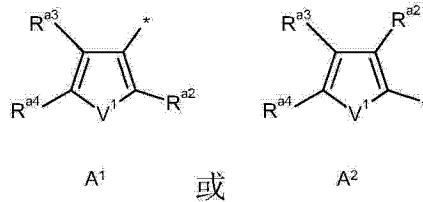
4. 一种式 (I) 的化合物及其盐 :



(I)

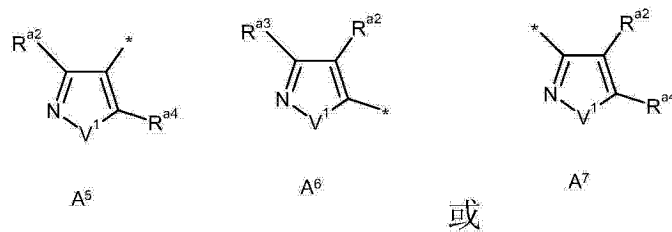
式中 :

- A 表示 :



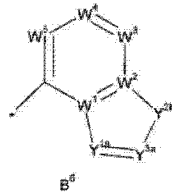
其中 V¹表示 O、S 或 NR^{a1}, 或者

A 表示 :



其中 V¹表示 NR^{a1};

- R^{a1}表示 C₁-C₈烷基 ;
- R^{a2}-R^{a4}独立地表示氢原子、卤原子、C₁-C₈烷基 ; 包含最多 9 个可以相同或不同的卤原子的 C₁-C₈卤代烷基 ; 或者 C₁-C₈烷氧基 ;
- B 表示 :



- W^1-W^5 , Y^{1a} 和 Y^{3a} 独立地表示 CR^{b3} ,条件是 W^1 和 W^2 都表示 C ;
- Y^{2b} 表示 NR^{b2} ;
- T 表示 O 或 S ;
- Z^1 表示 C_1-C_8 烷基取代的 C_3-C_7 环烷基 ;
- Z^2 表示氢原子、 C_1-C_8 烷基或 C_1-C_8 烷氧基羰基 ;
- Z^3 表示氢原子 ;
- R^{b3} 表示氢原子 ;卤素原子 ;硝基 ; C_1-C_8 - 烷基 ;包含最多 9 个可以相同或不同的卤素原子的 C_1-C_8 - 卤代烷基 ; C_1-C_8 - 烷基氨基 ; C_1-C_8 - 烷氧基 ;

R^{b2} 表示 C_1-C_8 - 烷基。

5. 如权利要求 1-4 中任一项所述的化合物,其特征在于,

- A 表示 A^5 ;
- V^1 表示 NR^{a1} ;
- R^{a1} 表示 C_1-C_8 - 烷基 ;
- R^{a2} 和 R^{a4} ,可以相同或不同,表示氢原子、卤原子、 C_1-C_8 - 烷基、最多包含 9 个相同或不同卤原子的 C_1-C_8 - 卤代烷基。

6. 如权利要求 1-4 中任一项所述的化合物,其特征在于, Z^1 表示 C_1-C_8 烷基取代的环丙基。

7. 如权利要求 1-4 中任一项所述的化合物,其特征在于, Z^2 表示氢原子或 C_1-C_8 烷基。

8. 一种杀真菌组合物,其包含有效量的作为活性组分的如权利要求 1 至 7 中任一项所述的通式 (I) 的化合物以及农业上可接受的担体。

9. 一种控制作物的植物病原真菌的方法,其特征在于,将农药有效且基本上无植物毒性量的如权利要求 1 至 7 中任一项所述的化合物或者如权利要求 8 所述的组合物施用到植物生长或者能够生长的土壤,施用到植物叶子和 / 或植物果实上,或者施用到植物种子上。

杀真菌剂 N-6 元稠合 (杂) 芳基 - 亚甲基 -N- 环烷基羧酰胺衍生物

[0001] 本发明专利申请是国际申请号为 PCT/EP2008/060040, 国际申请日为 2008 年 7 月 31 日, 进入中国国家阶段的申请号为 200880101329. X, 名称为“杀真菌剂 N-6 元稠合 (杂) 芳基 - 亚甲基 -N- 环烷基羧酰胺衍生物”的发明专利申请的分案申请。

发明领域

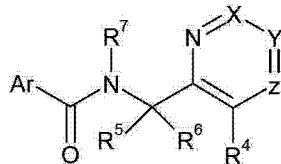
[0002] 本发明涉及 N- (芳香族, 6 元环, 稠合 (杂) 芳基 - 亚甲基) -N- 环烷基羧酰胺衍生物、其硫代羧酰胺 (thiocarboxamide)、或 N- 取代的甲脒 (carboximidamide) 衍生物、它们的制备方法、它们作为杀真菌剂活性剂的应用—尤其是以杀真菌剂组合物的形式、以及使用这些化合物或者组合物防控植物病原真菌 (特别是植物的植物病原真菌) 的方法。

背景技术

[0003] 国际专利申请 WO-2001/11966 一般性地提及了卤代烷基 -2- 吡啶基 - 亚甲基 - 杂环 - 酰胺衍生物。然而, 该文献中未披露任何被环烷基取代的任何衍生物。

[0004] 国际专利申请 WO-2004/074259 揭示了可以结合 GABAA 受体的以下通式的化合物:

[0005]

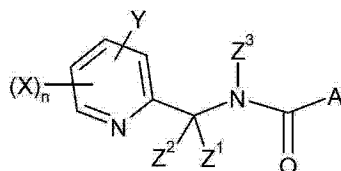


[0006] 式中 Ar 表示 5- 元至 10- 元杂环, R^7 表示 C_3 - C_7 - 环烷基, 而 X、Y 和 Z 表示 N 或 CR^1 , 至少一个是表示 N。

[0007] 然而, 该文献中未披露任何具有 5 元杂环或者连接于氮原子的环烷基的化合物。

[0008] 国际专利申请 WO-2006/120224 揭示了以下通式的 2- 吡啶基 - 亚甲基 - 羧酰胺衍生物:

[0009]



[0010] 该文献中无任何依据该发明制备杀真菌剂双环衍生物的暗示。

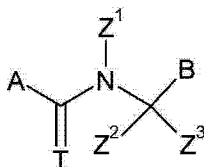
[0011] 国际专利申请 WO-2007/117778 披露了可用作诱发二氧化氮合成酶抑制剂的喹啉衍生物, 包括 N- 环丙基 -N-((7, 8- 氟 -2- 氧 -1, 2- 二氢喹啉 -4- 基) 甲基) -4- 甲基噻唑 -5- 羧酰胺和 N- 环丙基 -N-((8- 氟 -2- 氧 -1, 2- 二氢喹啉 -4- 基) 甲基) -4- 甲基噻唑 -5- 羧酰胺。这些化合物并不构成本发明的一部分。

[0012] 在农业领域中人们始终非常关注新杀虫剂化合物的应用, 以避免或防控活性成份

有耐药性的菌株的产生。同样非常关注使用比已知化合物活性更高的化合物,目标是降低所使用的活性化合物的量,与此同时维持至少与已知化合物相当的效力。我们现已发现一类拥有上述效果和优点的新化合物族。

[0013] 因此,本发明提供以下通式(I)的N-(芳香族6元稠合(杂)芳基-亚甲基)-N-环烷基-羧酰胺衍生物及其盐、N-氧化物、金属络合物、准金属络合物(metalloidalic complex)和光学活性异构体或几何异构体:

[0014]



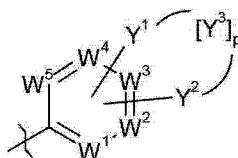
(I)

[0015] 式中:

[0016] • A 表示碳连接的、部分饱和或不饱和的5元杂环,该环可被最多4个基团R^a取代;

[0017] • B 表示

[0018]



[0019] 式中:

[0020] ○ W¹到W⁵独立地表示N或CR^{b1};

[0021] ○ Y¹到Y³独立地表示N、O、S、NR^{b2}或CR^{b3};

[0022] ○ Y¹到Y³与它们所连接的原子Wⁿ一起形成一个包含最多4个杂原子的芳香族5-或6-元稠合杂环,或者一个芳香族6元稠合碳环;

[0023] ○ p 表示1或2;

[0024] • T 表示O、S、N-R^c、N-OR^d、N-NR^eR^d或N-CN;

[0025] • Z¹表示未取代的C₃-C₇-环烷基或被最多10个相同或不同的原子或基团取代的C₃-C₇环烷基,所述原子或基团选自下组:卤原子;氰基;C₁-C₈-烷基;最多包含9个相同或不同卤原子的C₁-C₈-卤代烷基;C₁-C₈-烷氧基;最多包含9个相同或不同卤原子的C₁-C₈-卤代烷氧基;C₁-C₈-烷氧基羰基;最多包含9个相同或不同卤原子的C₁-C₈-卤代烷氧基羰基;C₁-C₈-烷基氨基羰基;二-(C₁-C₈-烷基)氨基羰基;

[0026] • Z²和Z³独立地表示氢原子、卤原子、C₁-C₈-烷基、最多包含9个相同或不同卤原子的C₁-C₈-卤代烷基、C₂-C₈-烯基、C₂-C₈-炔基、氰基、硝基、C₁-C₈-烷氧基、C₂-C₈-烯氧基、C₂-C₈-炔氧基、C₃-C₇-环烷基、C₁-C₈-烷基次磺酰基、氨基、C₁-C₈-烷基氨基、二-(C₁-C₈-烷基)氨基、C₁-C₈-烷氧基羰基、C₁-C₈-烷基羰基、C₁-C₈-烷基氨基甲酰基、二-(C₁-C₈-烷基)氨基甲酰基、N-C₁-C₈-烷基-C₁-C₈-烷氧基氨基甲酰基;或

[0027] • Z²和Z³与它们连接的碳原子一起形成取代或未取代的C₃-C₇环烷基;

[0028] • R^a独立地表示氢原子;卤素原子;氰基;硝基;氨基;硫烷基(sulfanyl);羟基;

五氟- λ -6-硫烷基; C_1-C_8 -烷基氨基; 二-(C_1-C_8 -烷基)氨基; 三(C_1-C_8 -烷基)甲硅烷基; 三(C_1-C_8 -烷基)甲硅烷基- C_1-C_8 -烷基; C_1-C_8 -烷基硫烷基; 包含最多9个可以相同或不同的卤素原子的 C_1-C_8 -卤代烷基硫烷基; C_1-C_8 -烷基; 包含最多9个可以相同或相异的卤素原子的 C_1-C_8 -卤代烷基; C_2-C_8 -烯基; 包含最多9个可以相同或不同的卤素原子的 C_2-C_8 -卤代烯基; C_2-C_8 -炔基; 包含最多9个可以相同或不同的卤素原子的 C_2-C_8 -卤代炔基; C_1-C_8 -烷氧基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基; 包含最多9个可以相同或不同的卤素原子的 C_1-C_8 -卤代烷氧基; C_2-C_8 -烯氧基; C_2-C_8 -炔氧基; C_3-C_7 -环烷基; C_3-C_7 -环烷基- C_1-C_8 -烷基; C_1-C_8 -烷基亚磺酰基; C_1-C_8 -烷基磺酰基; C_1-C_8 -烷氧基亚氨基; (C_1-C_8 -烷氧基亚氨基)- C_1-C_8 -烷基; (苄氧基亚氨基)- C_1-C_8 -烷基; C_1-C_8 -烷基羰基; 包含最多9个可以相同或不同的卤素原子的 C_1-C_8 -卤代烷基羰基; C_1-C_8 -烷氧基羰基; 包含最多9个可以相同或不同的卤素原子的 C_1-C_8 -卤代烷氧基羰基; C_1-C_8 -烷基氨基羰基、二-(C_1-C_8 -烷基)氨基羰基;

[0029] • R^c 和 R^d , 可以相同或不同, 表示氢原子; C_1-C_8 -烷基; 最多包含9个相同或不同卤原子的 C_1-C_8 -卤代烷基; C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基; C_2-C_8 -烯基; 最多包含9个相同或不同卤原子的 C_2-C_8 -卤代烯基; C_2-C_8 -炔基; 最多包含9个相同或不同卤原子的 C_2-C_8 -卤代炔基; C_3-C_7 -环烷基; C_3-C_7 -环烷基- C_1-C_8 -烷基; 最多包含9个相同或不同卤原子的 C_3-C_7 -卤代环烷基; 甲酰基; C_1-C_8 -烷基羰基; 最多包含9个相同或不同卤原子的 C_1-C_8 -卤代烷基羰基; C_1-C_8 -烷基磺酰基; 最多包含9个相同或不同卤原子的 C_1-C_8 -卤代烷基磺酰基; 可被最多5个基团Q取代的苯基; 可被最多6个基团Q取代的萘基; 可被最多5个基团Q取代的苯基亚甲基; 可被最多5个基团Q取代的苯基磺酰基;

[0030] • R^{b1} 和 R^{b3} 独立地表示氢原子; 卤素原子; 硝基; 氰基; 羟基; 硫烷基; 氨基; 五氟- λ -6-硫烷基; C_1-C_8 -烷基; 包含最多9个可以相同或不同的卤素原子的 C_1-C_8 -卤代烷基; C_1-C_8 -烷基氨基; 二-(C_1-C_8 -烷基)氨基; C_1-C_8 -烷氧基; 包含最多9个可以相同或不同的卤素原子的 C_2-C_8 -卤代烷氧基; C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基; C_1-C_8 -烷基硫烷基; 包含最多9个可以相同或不同的卤素原子的 C_1-C_8 -卤代烷基硫烷基; C_1-C_8 -烷基次磺酰基; 包含最多9个可以相同或不同的卤素原子的 C_1-C_8 -卤代烷基次磺酰基; C_1-C_8 -烷基亚磺酰基; 包含最多9个可以相同或不同的卤素原子的 C_1-C_8 -卤代烷基亚磺酰基; C_1-C_8 -烷基磺酰基; 包含最多9个可以相同或不同的卤素原子的 C_1-C_8 -卤代烷基磺酰基; C_2-C_8 -烯基; 最多包含9个相同或不同卤原子的 C_2-C_8 -卤代烯基; C_2-C_8 -炔基; 最多包含9个相同或不同卤原子的 C_2-C_8 -卤代炔基; C_2-C_8 -烯氧基; 最多包含9个相同或不同卤原子的 C_2-C_8 -卤代烯氧基; C_2-C_8 -炔氧基; 最多包含9个相同或不同卤原子的 C_2-C_8 -卤代炔氧基; C_3-C_7 -环烷基; C_3-C_7 -环烷基- C_1-C_8 -烷基; 最多包含9个相同或不同卤原子的 C_3-C_7 -卤代环烷基; 甲酰基; 甲酰氧基; 甲酰氨基; 羧基; 氨基甲酰基; N-羟基氨基甲酰基; 氨基甲酸酯; (羟基亚氨基)- C_1-C_8 -烷基; C_1-C_8 -烷基羰基; 包含最多9个可以相同或不同的卤素原子的 C_1-C_8 -卤代烷基羰基; N- C_1-C_8 -烷基- C_1-C_8 -烷氧基氨基甲酰基; C_1-C_8 -烷氧基羰基; 包含最多9个可以相同或不同的卤素原子的 C_1-C_8 -卤代烷氧基羰基; C_1-C_8 -烷基氨基羰基; 二-(C_1-C_8 -烷基)氨基羰基; C_1-C_8 -烷基羰氧基; 包含最多9个可以相同或不同的卤素原子的 C_1-C_8 -卤代烷基羰氧基; C_1-C_8 -烷基羰基氨基; C_1-C_8 -烷基氨基羰氧基; 二-(C_1-C_8 -烷基)氨基羰氧基; C_1-C_8 -烷氧基羰氧基; C_1-C_8 -烷氧基亚氨基; (C_1-C_8 -烷氧基亚氨基)- C_1-C_8 -烷基; (C_1-C_8 -烯氧基亚氨基)- C_1-C_8 -烷基; (C_1-C_8 -炔氧基亚氨基)- C_1-C_8 -烷基; (苄氧基亚氨基)- C_1-C_8 -烷基

基；三(C₁-C₈-烷基)甲硅烷基；三(C₁-C₈-烷基)甲硅烷基-C₁-C₈-烷基；最多可由5个基团Q取代的苯基；最多可由5个基团Q取代的苄氧基；最多可由5个基团Q取代的苄基硫烷基；最多可由5个基团Q取代的苄基氨基；最多可由5个基团Q取代的苯氧基；最多可由5个基团Q取代的苯氨基；最多可由5个基团Q取代的苯基硫烷基；最多可由5个基团Q取代的苄基；最多可由4个基团Q取代的吡啶基和最多可由4个基团Q取代的吡啶氧基；

[0031] • R^{b2}表示氢原子；C₁-C₈-烷基；最多包含9个相同或不同卤原子的C₁-C₈-卤代烷基；C₁-C₈-烷氧基-C₁-C₈-烷基；C₂-C₈-烯基；最多包含9个相同或不同卤原子的C₂-C₈-卤代烯基；C₂-C₈-炔基；最多包含9个相同或不同卤原子的C₂-C₈-卤代炔基；C₃-C₇-环烷基；C₃-C₇-环烷基-C₁-C₈-烷基；最多包含9个相同或不同卤原子的C₃-C₇-卤代环烷基；甲酰基；C₁-C₈-烷基羰基；最多包含9个相同或不同卤原子的C₁-C₈-卤代烷基羰基；C₁-C₈-烷基磺酰基；最多包含9个相同或不同卤原子的C₁-C₈-卤代烷基磺酰基；可被最多5个基团Q取代的苯基磺酰基；可被最多5个基团Q取代的苄基；

[0032] • Q, 可以相同或不同, 表示卤原子；氰基；硝基；C₁-C₈-烷基；C₁-C₈-烷氧基；C₁-C₈-烷基硫烷基；最多包含9个相同或不同卤原子的C₁-C₈-卤代烷基；最多包含9个相同或不同卤原子的C₁-C₈-卤代烷氧基；三(C₁-C₈)烷基甲硅烷基和三(C₁-C₈)烷基甲硅烷基-C₁-C₈-烷基；C₁-C₈-烷氧基亚氨基；(C₁-C₈-烷氧基亚氨基)-C₁-C₈-烷基；

[0033] 条件是式(I)的化合物不同于N-环丙基-N-((6,8-二甲基-2-氧-1,2-二氢喹啉-3-基)甲基)-呋喃-2-羧酰胺、N-环丙基-N-((6-乙氧基-2-氧-1,2-二氢喹啉-3-基)甲基)-呋喃-2-羧酰胺、N-环丙基-N-((6-甲基-2-氧-1,2-二氢喹啉-3-基)甲基)-呋喃-2-羧酰胺、N-环丙基-N-((7,8-二氟-2-氧-1,2-二氢喹啉-4-基)甲基)-4-甲基噻唑-5-羧酰胺和N-环丙基-N-((8-氟-2-氧-1,2-二氢喹啉-4-基)甲基)-4-甲基噻唑-5-羧酰胺。

[0034] 本发明的任何化合物可依据该化合物中立体单元(符合IUPAC规则的)的数目而以一种或多种立体异构体的形式存在。因而本发明同样地涉及所有立体异构体以及所有可能的立体异构体按所有比例的混合物。这些立体异构体可以根据本领域技术人员所熟知的方法进行分离。

[0035] 依据本发明, 以下通用术语一般按以下含义使用：

[0036] • 卤素是指氟、氯、溴或碘；

[0037] • 杂原子可以是氮、氧或硫；

[0038] • 卤代基团, 尤其卤代烷基、卤代烷氧基和卤代环烷基, 最多可包含9个相同或不同的卤原子；

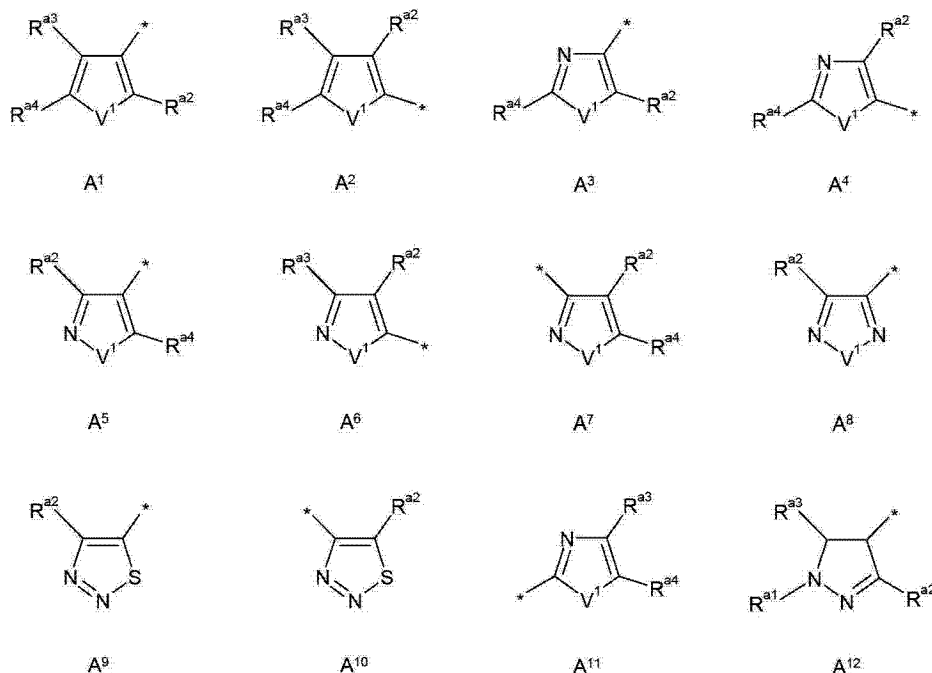
[0039] • 任何烷基、烯基或炔基可以是直链或支链的；

[0040] • 术语“芳基”表示苯基或萘基, 可任选地被1-5个选自下组的基团取代：卤素、[C₁-C₆]-烷基、[C₁-C₆]-卤代烷基、[C₂-C₆]-烯基、[C₂-C₆]-卤代烯基、[C₂-C₆]-炔基、[C₂-C₆]-卤代炔基、[C₁-C₆]-烷氧基、[C₁-C₄]-烷氧基-[C₁-C₄]-烷基、[C₁-C₄]-烷氧基-[C₁-C₄]-烷氧基、[C₁-C₆]-卤代烷氧基和[C₁-C₄]-卤代烷氧基-[C₁-C₄]-烷基；

[0041] • 在氨基或任何其它含氨基的基团的氨基部分被两个可以相同或不同的取代基取代的情况, 则这两个取代基可以与它们连接的氮原子一起形成一个可以被取代或者可以包括其它杂原子的杂环基团, 优选5元-7元杂环基团, 例如吗啉基或者哌啶基。

[0042] 优选的本发明通式(I)的化合物是其中 A 选自下组的化合物：

[0043]



[0044] 式中：

[0045] • -* 表示与羰基连接的位置；

[0046] • V¹表示 O、S、或 NR^{a1}；

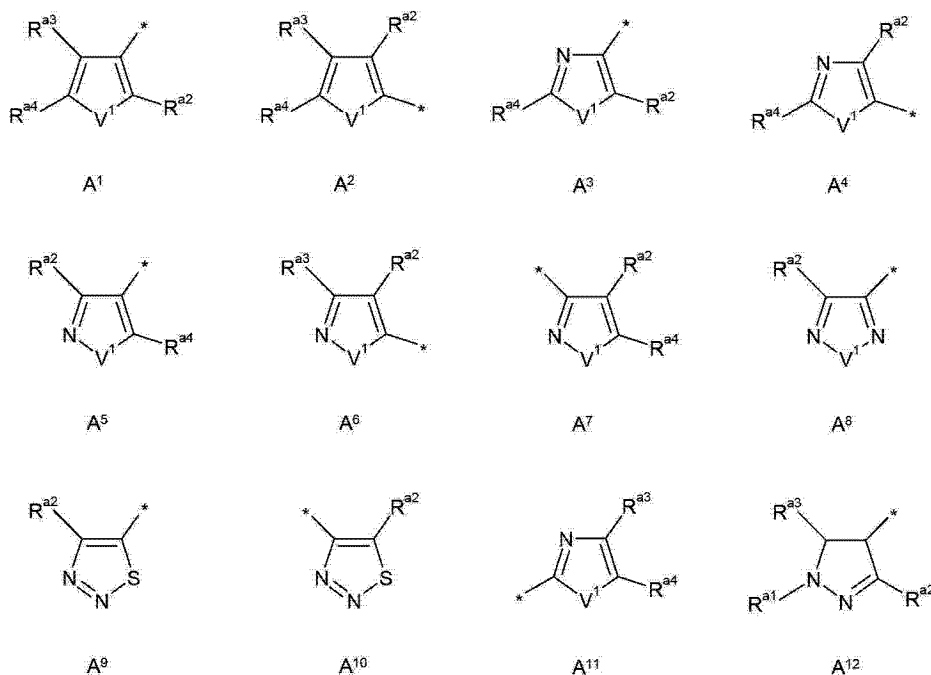
[0047] • R^{a1}表示氢原子、C₁-C₈-烷基、包含最多 9 个可以相同或不同的卤素原子的 C₁-C₈-卤代烷基、C₁-C₈-烷氧基 -C₁-C₈-烷基；

[0048] • R^{a2}和 R^{a3}，可以相同或不同，表示氢原子、卤原子、氰基、C₁-C₈-烷基、最多包含 9 个相同或不同卤原子的 C₁-C₈-卤代烷基、C₁-C₈-烷氧基或最多包含 9 个相同或不同卤原子的 C₁-C₈-卤代烷氧基、C₃-C₇-环烷基；

[0049] • R^{a4}表示氢原子、卤原子、氰基、C₁-C₈-烷基、最多包含 9 个相同或不同卤原子的 C₁-C₈-卤代烷基、C₁-C₈-烷氧基、最多包含 9 个相同或不同卤原子的 C₁-C₈-卤代烷氧基、C₃-C₇-环烷基、C₁-C₈-烷基硫烷基、氨基、C₁-C₈-烷基氨基、二-(C₁-C₈-烷基)氨基；C₁-C₈-烷氧基羰基；

[0050] 依据本发明的更优选的通式(I)的化合物是其中 A 选自下组的化合物：

[0051]



[0052] 式中：

[0053] • -* 表示与羰基连接的位置；

[0054] • V¹表示 O、S、或 NR^{a1}；

[0055] • R^{a1}表示氢原子、C₁-C₈-烷基、C₁-C₈-烷氧基 -C₁-C₈-烷基；

[0056] • R^{a2}表示 C₁-C₈-烷基、包含最多 9 个可以相同或不同的卤素原子的 C₁-C₈-卤代烷基、C₁-C₈-烷氧基；

[0057] • R^{a3}表示氢原子、卤原子或 C₁-C₈-烷基；

[0058] • R^{a4}表示氢原子、卤原子、C₁-C₈-烷基、或最多包含 9 个可以相同或不同卤原子的 C₁-C₈-卤代烷基；

[0059] 依据本发明的其它更优选的式(I)化合物是具有以下特征的化合物：

[0060] • A 表示 A⁵；

[0061] • V¹表示 NR^{a1}；

[0062] • R^{a1}表示 C₁-C₈-烷基；

[0063] • R^{a2}和 R^{a3}，可以相同或不同，表示氢原子、卤原子、C₁-C₈-烷基、最多包含 9 个相同或不同卤原子的 C₁-C₈-卤代烷基；或

[0064] • A 表示 A⁴；

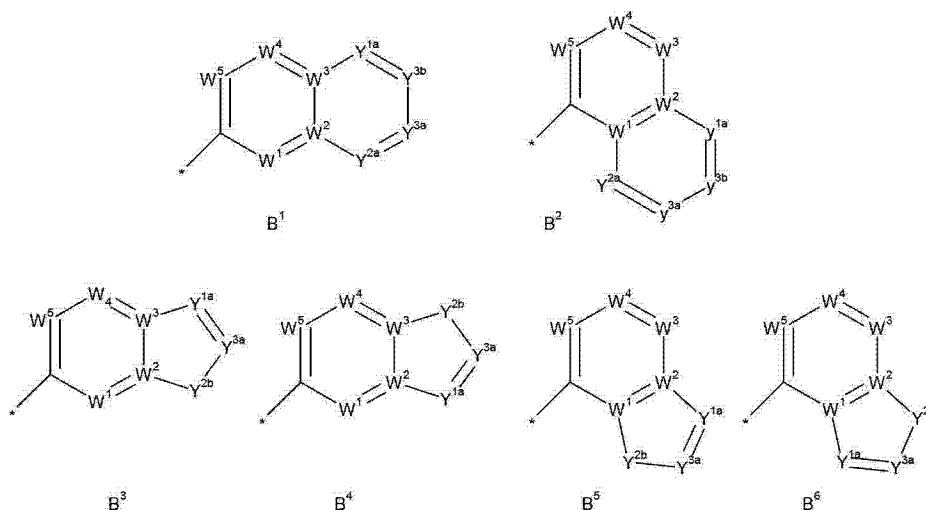
[0065] • V¹表示 S；

[0066] • R^{a2}表示 C₁-C₈-烷基、包含最多 9 个可以相同或不同的卤素原子的 C₁-C₈-卤代烷基；

[0067] • R^{a4}表示氢原子、C₁-C₈-烷基、最多包含 9 个相同或不同卤原子的 C₁-C₈-卤代烷基。

[0068] 依据本发明的更优选的通式(I)的化合物是其中 B 选自下组的化合物：

[0069]



[0070] 式中：

[0071] • W¹至 W⁵、Y^{1a}、Y^{2a}、Y^{3a}和 Y^{3b}独立地表示 NR^{b2}或 CR^{b3}；

[0072] • Y^{2b}表示 O、S、或 NR^{b2}。

[0073] 其他更优选的依据本发明的通式(I)的化合物是其中 B 表示 B¹或 B²；W¹至 W⁵、Y^{1a}、Y^{2a}、Y^{3a}和 Y^{3b}独立地表示 CR^{b3}；或 B 表示 B⁵或 B⁶；W¹至 W⁵、Y^{1a}和 Y^{3a}独立地表示 CR^{b1}；Y^{2b}表示 S 的化合物。

[0074] 其他优选的依据本发明的式(I)化合物是其中 T 表示 O 或 S 的化合物。

[0075] 其他优选的依据本发明的式(I)化合物是其中 Z¹表示环丙基的化合物。

[0076] 其他更优选的依据本发明的式(I)化合物是其中 Z²和 Z³独立地表示氢原子或 C₁-C₈-烷基的化合物。

[0077] 其他更优选的依据本发明的式(I)化合物是其中 Q 表示卤素原子、C₁-C₈-烷基、C₁-C₈-烷氧基、包含最多 9 个可以相同或不同的卤素原子的 C₁-C₈-卤代烷基、包含最多 9 个可以相同或不同的卤素原子的 C₁-C₈-卤代烷氧基的化合物。

[0078] 上述关于依据本发明的式(I)化合物中取代基的优选方案可以以各种方式组合，或者是单独地，或者是部分地或完整地组合。优选特征的组合提供了依据本发明的化合物的子类(sub-class)。此类依据本发明的优选化合物的子类的例子可以组合以下特征：

[0079] -A 的优选特征与 T、Z¹到 Z³、R^a、R^b、T、V¹和 Q 中的一种或多种的优选特征；

[0080] -T 的优选特征与 A、Z¹到 Z³、R^a、R^b、V¹和 Q 中的一种或多种的优选特征；

[0081] -Z¹的优选特征与 A、T、Z²、Z³、R^a、R^b、V¹和 Q 中的一种或多种的优选特征；

[0082] -Z²的优选特征与 A、T、Z¹、Z³、R^a、R^b、V¹和 Q 中的一种或多种的优选特征；

[0083] -Z³的优选特征与 A、T、Z¹、Z²、R^a、R^b、V¹和 Q 中的一种或多种的优选特征；

[0084] -R^a的优选特征与 A、T、Z¹到 Z³、R^b、V¹和 Q 中的一种或多种的优选特征；

[0085] -R^b的优选特征与 A、T、Z¹到 Z³、R^a、V¹和 Q 中的一种或多种的优选特征；

[0086] -V¹的优选特征与 A、T、Z¹到 Z³、R^a、R^b和 Q 中的一种或多种的优选特征；

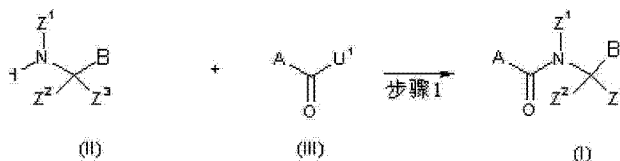
[0087] -Q 的优选特征与 A、T、Z¹到 Z³、R^a、R^b和 V¹中的一种或多种的优选特征；

[0088] 在这些依据本发明的化合物的取代基的优选特征的组合中，所述优选特征还可选自各 A、T、Z¹到 Z³、R^a、R^b、V¹和 Q 的更优选特征。

[0089] 此外，本发明还涉及式(I)化合物的制备方法。

[0090] 因此,依据本发明的又一方面,提供一种制备其中 T 表示 O 的式(I)化合物的方法 P1,如以下反应方案所示:

[0091]



[0092] 方法 P1

[0093] 式中:

[0094] • A、Z¹到 Z³、W¹到 W⁵和 B 如文中所定义;

[0095] • U¹表示卤原子或离去基团。

[0096] 在依据本发明的方法 P1 中,如果合适,步骤 1 可以在溶剂的存在下进行,而且如果合适,还可以在酸结合剂 (acid bonder) 的存在下进行。

[0097] 式 (II) 的 N- 环烷基 - 胺衍生物是已知的或者可以用已知方法制备,比如醛或酮的还原氨化反应 (Bioorganics and Medicinal Chemistry Letters, 2006 年, p. 2014, 化合物 7 和 8 的合成), 或亚胺的还原 (Tetrahedron, 2005 年, p. 11689), 或者是卤素、甲磺酸酯 (mesylate) 或甲苯磺酸酯 (tosylate) 的亲核取代 (Journal of Medicinal Chemistry, 2002 年, 第 3887 页, 化合物 28 中间体的制备)。

[0098] 式 (III) 的羧酸衍生物是已知的, 或者可以采用已知方法制备 (WO-93/11117; EP-545099; Nucleosides&Nucleotides, 1987 年, p737-759; Bioorg. Med. Chem., 2002 年, 第 2105-2108 页)。

[0099] 在各种情况, 适合于进行依据本发明的方法 P1 的酸结合剂是此类反应惯用的无机碱或有机碱。优选使用碱土金属、碱金属氢化物, 碱金属氢氧化物或碱金属醇盐, 例如氢氧化钠、氢化钠、氢氧化钙、氢氧化钾、叔丁醇钾或其它氢氧化铵; 碱金属碳酸盐, 例如碳酸铯、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钾、碳酸氢钠; 碱金属或碱土金属乙酸盐, 例如乙酸钠、乙酸钾、乙酸钙; 以及叔胺类, 例如三甲胺、三乙胺、二异丙基乙胺、三丁胺、N, N- 二甲基苯胺、吡啶、N- 甲基哌啶、N, N- 二甲基氨基吡啶、二氮杂双环辛烷 (DABCO)、二氮杂双环壬烯 (DBN) 或二氮杂双环十一碳烯 (DBU)。

[0100] 也可以在不加入额外的缩合剂下进行反应, 或者使用过量的胺组分, 使得该组分可以同时作为酸结合剂。

[0101] 在各种情况, 适合于进行依据本发明的方法 P1 的溶剂可以是惯用的惰性有机溶剂。优选使用可任选卤代的脂族、脂环族或芳族烃类, 例如石油醚、己烷、庚烷、环己烷、甲基环己烷、苯、甲苯、二甲苯或萘烷; 氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷; 醚类, 例如乙醚、二异丙醚、甲基叔丁基醚、甲基叔戊基醚、二噁烷、四氢呋喃、1, 2- 二甲氧基乙烷、1, 2- 二乙氧基乙烷或茴香醚; 腈类, 例如乙腈、丙腈、正丁腈或异丁腈或苯甲腈; 酰胺类, 例如 N, N- 二甲基甲酰胺、N, N- 二甲基乙酰胺、N- 甲基甲酰苯胺、N- 甲基吡咯烷酮、或六甲基磷酰三胺; 酯类, 例如乙酸甲酯或乙酸乙酯; 亚砷类, 例如二甲亚砷; 或砷类, 例如环丁砷。

[0102] 当进行依据本发明的方法 P1 时, 反应温度可以在相对较宽的范围内变化。一般而言, 依据本发明的方法在 0° C 和 160° C 之间的温度进行, 优选在 10° C 和 120° C 之间

的温度进行。一种控制依照本发明的方法的温度的方式是使用微波技术。

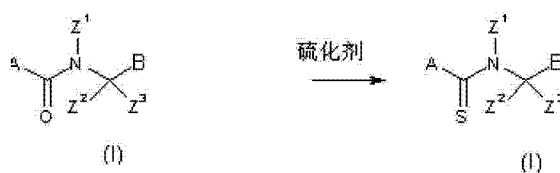
[0103] 依据本发明的方法 P1 一般独立地在大气压下进行。然而,在各种情况中,也可在升压或减压的条件下进行。

[0104] 当进行依据本发明的方法 P1 的步骤 1 时,通常对于每摩尔的式(II)胺采用 1 摩尔或其它过量的式(III)酸衍生物以及 1 到 3 摩尔的酸结合剂。还可以其它比例使用反应组分。

[0105] 按照惯常方式进行后处理。一般而言,用水处理反应混合物,并分离出有机相,干燥后减压浓缩。如果合适,通过惯常方法如色谱法或重结晶法除去残留的残余物中任何可能仍存在的杂质。

[0106] 依据本发明的又一方面,提供一种制备其中 T 表示 S 的式(I)化合物的方法 P2,如以下反应方案所示:

[0107]



[0108] 方法 P2

[0109] 式中 A、Z¹到 Z³、W¹到 W⁵和 B 如文中所定义。

[0110] 方法 P2 可以在硫化剂存在下进行。

[0111] 式(I)的原料酰胺衍生物可以依据方法 P1 制备。

[0112] 适合于进行依据本发明的方法 P2 的硫化剂可以是硫(S)、硫化氢(H₂S)、硫化钠(Na₂S)、硫氢化钠(NaHS)、三硫化二硼(B₂S₃)、硫化双(二乙基铝)((AlEt₂)₂S)、硫化铵((NH₄)₂S)、五硫化二磷(P₂S₅)、罗威森试剂(Lawesson's reagent)(2,4-双(4-甲氧基苯基)-1,2,3,4-二硫杂二磷杂环丁烷(dithiadiphosphetane)2,4-二硫化物)或以聚合物为载体的硫化剂,例如参见 J. Chem. Soc. Perkin1, (2001 年), 358 页,该方法可以在有或没有催化量、符合化学计量比的量或过量的碱如无机碱或有机碱存在的情况下进行。优选使用碱金属碳酸盐,例如碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钾、碳酸氢钠;杂环芳族碱,例如吡啶、甲基吡啶、二甲基吡啶、三甲基吡啶;以及叔胺类,例如三甲胺、三乙胺、三丁胺、N,N-二甲苯胺、N,N-二甲氨基吡啶或 N-甲基哌啶。

[0113] 适合于执行本发明的方法 P2 的溶剂可以是惯用的惰性有机溶剂。优选使用任选卤代的脂族、脂环族或芳族烃类,例如石油醚、己烷、庚烷、环己烷、甲基环己烷、苯、甲苯、二甲苯或萘烷;氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷;醚类,例如乙醚、二异丙醚、甲基叔丁基醚、甲基叔戊基醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、或 1,2-二乙氧基乙烷;腈类,例如乙腈、丙腈、正丁腈或异丁腈或苯甲腈;含硫溶剂,例如环丁砜或二硫化碳。

[0114] 当进行依据本发明的方法 P2 时,反应温度可以在相对较宽的范围内变化。一般而言,这些方法在 0-160° C,优选在 10-120° C 的温度下进行。一种控制依照本发明的方法的温度的方式是使用微波技术。

[0115] 依据本发明的方法 P2 一般在大气压下进行。也可以在升压或减压的条件下进行。

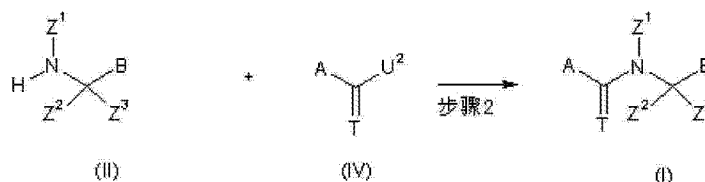
[0116] 当进行依据本发明的方法 P2 时,对于每摩尔通式 (I) 的酰胺衍生物,可以采用 1 摩尔或者过量的硫当量的硫化剂以及 1 到 3 摩尔的碱。

[0117] 还可以其它比例使用反应组分。按照已知方式进行后处理。

[0118] 通常,反应混合物减压浓缩。通过已知的方法如色谱法或重结晶法除去残留的残余物中任何可能仍存在的杂质。

[0119] 依据本发明的又一方面,提供一种制备其中 T 表示 N-R^c、N-OR^d、N-NR^cR^d或 N-CN 的式 (I) 化合物的方法 P3,如以下反应方案所示:

[0120]



[0121] 方法 P3

[0122] 式中:

[0123] • A、Z¹到 Z³、W¹到 W⁵和 B 如文中所定义;

[0124] • U²表示氯原子或甲基硫烷基。

[0125] 在依据本发明的方法 P3 中,步骤 2 可以在酸结合剂存在下,并在溶剂的存在下进行。

[0126] 式 (II) 的 N-环烷基-胺衍生物是已知的或者可以用已知方法制备,比如醛或酮的还原氨化反应 (Bioorganics and Medicinal Chemistry Letters, 2006 年, p. 2014, 化合物 7 和 8 的合成),或者是亚胺的还原 (Tetrahedron, 2005 年, p. 11689),或者是卤素、甲磺酸酯 (mesylate) 或甲苯磺酸酯 (tosylate) 的亲核取代 (Journal of Medicinal Chemistry, 2002 年, 第 3887 页, 化合物 28 中间体的制备)。

[0127] 式 (IV) 的 N-取代羧酰亚胺酰氯 (carboximidoyl chloride) 是已知的或者可以用已知方法制备,例如参见 Houben-Weyl 的“有机化学方法(Methoden der organischen Chemie)”(1985 年), E5/1, 628-633 页和 Patai 的“脒类和亚酰胺化物的化学(The chemistry of amidines and imidates)”, (1975 年), 296-301 页。

[0128] 式 (IV) 的 N-取代的或 N,N-二取代的脒酰氯 (hydrazonoyl chloride) 是已知的或可以用已知方法制备,例如参见 Tetrahedron, 1991 年, 47, 第 447 页和 Journal of Heterocyclic Chemistry, 1983 年, 20, 第 225 页。

[0129] 式 (IV) 的 N-氰基羧亚酰胺酰氯是已知的或可以用已知方法制备,例如参见 Tetrahedron Letters, 1968 年, 第 5523 页和 Bioorganic and Medicinal Chemistry, 2006 年, 第 4723 页。

[0130] 适合于执行依据本发明的方法 P3 的酸结合剂可以是此类反应惯用的无机碱或有机碱。优选使用碱土金属或碱金属氢氧化物,例如氢氧化钠、氢氧化钙、氢氧化钾或其它氢氧化铵衍生物;碱金属碳酸盐,例如碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钾、碳酸氢钠;碱金属或碱土金属乙酸盐,例如乙酸钠、乙酸钾、乙酸钙;碱土金属或碱金属氢化物,例如氢化钠或氢化钾;碱土金属或碱金属醇盐 (alcoholate),例如甲醇钠、乙醇钠、丙醇钠或叔丁醇钾;以及叔胺,例如三甲胺、三乙胺、三丁胺、N,N-二甲基苯胺、吡啶、N-甲基哌啶、N,N-二甲基氨基吡啶、

二氮杂二环辛烷 (DABCO)、二氮杂二环壬烯 (DBN) 或二氮杂二环十一碳烯 (DBU) ;或者聚合物支撑的除酸剂 (例如, <http://www.iris-biotech.de/downloads/scavengers.pdf> 中详细描述)。

[0131] 也可以在没有任何附加的酸结合剂的情况下进行反应。

[0132] 适合于进行依据本发明的方法 P3 的溶剂可以是惯用的惰性有机溶剂。优选使用可任选卤代的脂族、脂环族或芳族烃类,例如石油醚、己烷、庚烷、环己烷、甲基环己烷、苯、甲苯、二甲苯或萘烷;氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷;醚类,例如乙醚、二异丙醚、甲基叔丁基醚、甲基叔戊基醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷或茴香醚;腈类,例如乙腈、丙腈、正丁腈或异丁腈或苯甲腈;酰胺类,例如 N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基甲酰苯胺、N-甲基吡咯烷酮、或六甲基磷酰三胺;酯类,例如乙酸甲酯或乙酸乙酯;亚砷类,例如二甲亚砷;或砷类,例如环丁砷。

[0133] 当进行依据本发明的方法 P3 时,反应温度可以在相对较宽的范围内变化。一般而言,这些方法在 0-160° C,优选在 10-120° C 的温度下进行。一种控制依照本发明的方法的温度的方式是使用微波技术。

[0134] 依据本发明的方法 P3 一般在大气压下进行。也可以在升压或减压的条件下进行。

[0135] 当执行依据本发明的方法 P3 时,式(III)的胺衍生物可以用其盐,例如盐酸盐(chlorhydrate)或者任何其它方便的盐。

[0136] 当执行依据本发明的方法 P3 时,对于每摩尔式(IV)的 N-取代羧亚酰胺酰氯可以采用 1 摩尔或者过量的式(II)的胺衍生物以及 1 到 3 摩尔的酸结合剂。

[0137] 还可以其它比例使用反应组分。按照已知方式进行后处理。

[0138] 通常,反应混合物在减压下浓缩。通过已知的方法如色谱法或重结晶法除去残留的残余物中任何可能仍存在的杂质。

[0139] 本发明的化合物可以按上述方法制备。但应理解,本领域技术人员基于其一般知识以及可获得的出版物,能够根据所需合成的本发明的各种具体化合物对本发明方法进行相应调整。

[0140] 在又一方面,本发明还涉及包含有效但非植物毒性量的式(I)活性化合物的杀真菌组合物。

[0141] “有效但非植物毒性量”的表达方式是指本发明的组合物量足以控制或者破坏存在于或易于出现在农作物上的真菌,而该剂量并不会使所述农作物产生任何可以观察到的植物毒性症状。该量根据以下因素可以在较宽范围内变化:要控制的真菌、农作物类型、气候条件以及包含在本发明的杀真菌组合物中的化合物。这个量可以通过系统性田间试验来确定,此系本领域技术人员能力范围之内。

[0142] 因此,依据本发明,提供一种杀真菌剂组合物,该组合物包含有效量的在此定义的式(I)化合物作为活性成份、以及农业上可接受的担体(support)、载体或填料。

[0143] 依据本发明,术语“担体”表示天然或者合成的有机或无机的化合物,它与式(I)的活性化合物组合或者联合使用,使活性化合物更容易施用于植物,尤其是植物的各个部分。因此该担体通常是惰性的,而且应当是农业上可接受的。担体可以是固态的或者液态的。合适的担体的例子包括粘土、天然硅酸盐或合成硅酸盐、二氧化硅、树脂、蜡、固体肥料、水、醇

类(特别是丁醇)、有机溶剂、矿物油和植物油及其衍生物。也可使用这些担体的混合物。

[0144] 依据本发明的组合物还可以包含其它组分。特别地,组合物可以进一步包含表面活性剂。表面活性剂可以是离子型或非离子型的乳化剂、分散剂或润湿剂、或者这些表面活性剂的混合物。例如,可以提及的有聚丙烯酸盐、木质素磺酸盐、苯酚磺酸盐或萘磺酸盐、环氧乙烷与脂肪醇或与脂肪酸或与脂肪胺的缩聚物、取代的苯酚(特别是烷基苯酚或芳基苯酚)、磺基琥珀酸酯的盐类、牛磺酸衍生物(特别是烷基牛磺酸盐(alkyl taurate))、聚氧乙基化醇或酚的磷酸酯、多元醇的脂肪酸酯、以及包含硫酸、磺酸或磷酸官能团的上述化合物的衍生物。当活性化合物和/或惰性担体是不溶于水并且施用时的媒介试剂是水时,至少一种表面活性剂的存在通常是至关重要的。较佳地,表面活性剂含量可以占组合物重量的5-40重量%。

[0145] 可任选地,还可以包含附加的组分,例如,保护性胶体、粘合剂、增稠剂、触变剂、渗透剂、稳定剂、掩蔽剂(sequestering agent)。更一般地说,活性化合物可以按照常规配制技术与任何固态或液态添加剂组合。

[0146] 一般而言,本发明的组合物包含0.05重量%-99重量%的活性化合物,优选10重量%-70重量%。

[0147] 本发明的组合物可以以各种形式使用,例如气雾分散剂、胶囊悬浮剂(capsule suspension)、冷雾浓缩剂、可撒粉剂、可乳化的浓缩剂、水包油乳液、油包水乳液、包胶剂、细颗粒剂、用于种子处理的可流动浓缩剂、气体(压力下)制剂、气体发生剂、颗粒剂、热雾浓缩剂、大粒剂、微粒剂、油可分散性粉剂、油混溶性可流动浓缩剂、油混溶性液体、糊剂、植物小棒、用于干种处理的粉剂、农药包衣的种子、可溶性浓缩剂、可溶性粉剂、用于种子处理的溶液、悬浮浓缩剂(可流动的浓缩剂)、超低容量(ULV)液体、超低容量(ULV)悬浮剂、水可分散剂或片剂、用于浆液处理的水可分散粉剂、水溶性剂或片剂、用于种子处理的水溶性粉剂、以及可润湿性粉剂。这些组合物不仅包括通过合适的设备如喷雾或撒粉设备施用到待处理的植物或种子上的现成组合物,还包括在施用到农作物之前必须稀释的浓缩商品组合物。这些组合物不仅包括用合适的设备如喷雾器或撒粉设备等施用到待处理的植物或种子上的现成组合物,而且包括在施用于农作物之前必须进行稀释的浓缩商品组合物。

[0148] 依据本发明的化合物还可以与一种或多种以下物质混合:杀虫剂、杀真菌剂、杀细菌剂、引诱剂、杀螨剂或信息素活性物质或者其他有生物活性的化合物。如此获得的混合物通常具有光谱的活性。与其它杀真菌剂的混合物特别有益。

[0149] 合适的杀真菌剂混合伴侣的例子可以选自下组:

[0150] (1) 核酸合成的抑制剂,例如苯霜灵、苯霜灵-M(benlaxyl-M)、乙嘧啶磺酸酯、柯罗泽尔昆(clozylacon)、甲菌定、乙嘧啶、咪霜灵、恶霉灵、甲霜灵、高效甲霜灵、咪酰胺、恶霜灵和恶唑酸。

[0151] (2) 有丝分裂和细胞分化的抑制剂,例如苯菌灵、多菌灵、苯咪唑菌、乙霉威、噻唑菌胺、麦穗宁、戊菌隆、噻菌灵、硫菌灵、甲基硫菌灵和苯酰菌胺。

[0152] (3) 呼吸抑制剂,例如,用作CI-呼吸抑制剂的氟嘧菌胺;用作CII-呼吸抑制剂的百克芬(bixafen)、啶酰菌胺(boscalid)、萎锈灵、甲咪酰胺、氟酰胺、氟吡菌酰胺(fluopyram)、咪吡菌胺(furametpyr)、拌种胺、异赛派泽姆(isopyrazam)(9R-组分)、异赛派泽姆(9S-组分)、灭锈胺、氧化萎锈灵、吡噻菌胺(penthiopyrad)、噻氟菌胺;用作

CIII-呼吸抑制剂的吡唑磺菌胺 (amisulbrom)、嘧菌酯、氟霜唑、醚菌胺 (dimoxystrobin)、烯炔菌酯 (enestroburin)、恶唑菌酮、咪唑菌酮、氟嘧菌酯 (fluoxastrobin)、醚菌酯、苯氧菌胺、炔醚菌胺 (orysastrobin)、啉氧菌酯 (picoxystrobin)、双唑草腈 (pyraclostrobin)、嘧啉炔草醚、炔菌酯。

[0153] (4) 能够起解偶联剂作用的化合物, 例如乐杀螨、消螨普、氟啉胺和敌螨普 (meptyldinocap)。

[0154] (5) 能抑制 ATP 生产的抑制剂, 例如三苯基乙酸锡、三苯基氯化锡、三苯基氢氧化锡和硅噻菌胺 (silthiofam)。

[0155] (6) 氨基酸和 / 或蛋白质生物合成抑制剂, 例如胺扑灭 (andoprime)、灰瘟素、嘧菌环胺、春雷霉素、春雷霉素盐酸盐水合物、嘧菌胺和嘧霉胺。

[0156] (7) 信号转换抑制剂, 例如拌种咯、咯菌腈、和苯氧喹啉。

[0157] (8) 脂和膜合成抑制剂, 例如联苯、乙菌利、敌瘟磷、土菌灵、依杜卡 (iodocarb)、异稻瘟净、异菌脲、稻瘟灵、腐霉利、霜霉威、霜霉威盐酸盐、吡菌磷、甲基立枯磷和乙烯菌核利。

[0158] (9) 对麦角固醇生物合成的抑制剂, 例如阿尔迪莫 (aldimorph)、氧环唑、联苯三唑醇、糠菌唑、环丙唑醇、苄氯三唑醇、苯醚甲环唑、烯唑醇、烯唑醇 -M、吗菌啉、吗菌啉乙酸盐 (dodemorph acetate)、氟环唑、乙环唑、氯苯嘧啶醇、腈苯唑、环酰菌胺、苯锈啉、丁苯吗啉、氟唑唑、呋唑醇、氟硅唑、粉唑醇、呋菌唑、呋醚唑、己唑醇、抑霉唑、抑霉唑硫酸盐、亚胺唑、种菌唑、叶菌唑、腈菌唑、萘替芬 (naftifine)、氟苯嘧啶醇、恶咪唑、多效唑、稻瘟酯、戊菌唑、病花灵、咪鲜胺、丙环唑、丙硫菌唑 (prothioconazole)、稗草丹、啉斑炔、唑啉菌酮、硅氟唑、螺环菌胺、戊唑醇、特比萘芬 (terbinafine)、四氟醚唑、三唑酮、三唑醇、十三吗啉、氟菌唑、噻胺灵、灭菌唑、烯效唑、烯霜苄唑和伏立康唑 (voriconazole)。

[0159] (10) 细胞壁合成抑制剂, 例如苯噻菌胺 (benthiavalicarb)、烯酰吗啉、氟吗啉、异丙菌胺、双炔酰菌胺 (mandipropamid)、多抗霉素、多氧霉素 (polyoxorim)、硫菌威、有效霉素 A 和威乐耐 (valiphenal)。

[0160] (11) 黑素生物合成抑制剂, 例如环丙酰菌胺、双氯氰菌胺、氰菌胺、四氯苯酞、咯唑酮和三环唑。

[0161] (12) 能够诱导宿主防御的化合物, 例如活化酯 -S- 甲基、烯丙苯噻唑和噻酰菌胺 (tiadinil)。

[0162] (13) 具有多位点作用的化合物, 例如波尔多液、敌菌丹、克菌丹、百菌清、环烷酸铜、氧化铜、氯化铜、铜制剂如氢氧化铜、硫酸铜、苯氟磺胺、二氰蒽醌、多果定、多果定游离碱、福美铁、氟佛匹特 (fluorofolpet)、灭菌丹、双胍辛、双胍辛乙酸盐、双胍辛胺、双八胍盐 (iminooctadine albesilate)、双胍辛胺乙酸盐、代森锰铜、代森锰锌、代森锰、代森联、代森联锌 (metiram zinc)、啉啉铜、普罗帕脒 (propamidine)、丙森锌、硫磺、和包括多硫化钙的硫磺制剂、福美双、甲苯氟磺胺、代森锌和福美锌。

[0163] (14) 例如以下的化合物: 2, 3- 二丁基 -6- 氯噻吩并 [2, 3-d] 嘧啶 -4(3H) - 酮、(2Z) -3- 氨基 -2- 氰基 -3- 苯基 丙烯 -2- 酸 乙 酯、N-[2-(1, 3- 二甲基丁基) 苯基] -5- 氟 -1, 3- 二甲基 -1H- 吡唑 -4- 羧酰胺、N-{2-[1, 1'- 二(环丙基) -2- 基] 苯基} -3-(二氟甲基) -1- 甲基 -1H- 吡唑 -4- 羧酰胺、(2E) -2-(2-{[6-(3- 氯 -2- 甲

基苯氧基)-5-氟嘧啶-4-基]氧}苯基)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、(2E)-2-{2-[({(2E,3E)-4-(2,6-二氯苯基)亚丁-3-烯-2-基]氨基}氧)甲基]苯基}-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、2-氯-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)吡啶-3-羧酰胺、N-(3-乙基-3,5,5-三甲基环己基)-3-(甲酰氨基)-2-羟基苯甲酰胺、5-甲氧基-2-甲基-4-(2-[({(1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基}氨基)氧]甲基}苯基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮、(2E)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-2-(2-[({(1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基}氨基)氧基]甲基}苯基)乙酰胺、(2E)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-2-{2-[(E)-({1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基}亚氨基)甲基]苯基}乙酰胺、(2E)-2-{2-[({(1E)-1-(3-[(E)-1-氟-2-苯基乙烯基]氧基}苯基)亚乙基]氨基}氧)甲基]苯基}-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)环庚醇、1-(2,2-二甲基-2,3-二氢-1H-茛-1-基)-1H-咪唑-5-羧酸甲酯、N-乙基-N-甲基-N'-{2-甲基-5-(三氟甲基)-4-[3-(三甲基甲硅烷基)丙氧基]苯基}亚氨基甲酰胺、N'-{5-(二氟甲基)-2-甲基-4-[3-(三甲基甲硅烷基)丙氧基]苯基}-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、0-{1-[(4-甲氧基苯氧基)甲基]-2,2-二甲基丙基}1H-咪唑-1-硫羟酸酯(carbothioate)、N-[2-(4-{[3-(4-氯苯基)丙-2-炔-1-基]氧}-3-甲氧基苯基)乙基]-N2-(甲基磺酰基)缬氨酰胺(valinamide)、5-氯-7-(4-甲基哌啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶、5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇、霜霉威-三乙膦酸铝(propamocarb-fosetyl)、1H-咪唑-1-羧酸 1-[(4-甲氧基苯氧基)甲基]-2,2-二甲基丙酯、1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-4-羧酰胺、2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺酰基)吡啶、2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4H-色烯-4-酮、2-苯基苯酚及其盐、3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-1H-吡啶-4-羧酰胺、3,4,5-三氯吡啶-2,6-二腈、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基异噁唑烷-3-基]吡啶、3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基哒嗪、4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基哒嗪、8-羟基喹啉、8-羟基喹啉硫酸盐(2:1)(盐)、苯噻硫氰、苯赛清(bethoxazin)、卡巴西霉素(capsimycin)、香芹酮(carvone)、灭螨猛、地茂散、硫杂灵、环氟菌胺(cyflufenamid)、霜脲氰、赛皮磺酰胺(cyprosulfamide)、棉隆、咪菌威、双氯酚、哒菌酮、氯硝胺、野燕枯、苯敌快、二苯胺、乙克霉特(ecomate)、噻菌胺、氟酰菌胺、氟吡菌胺(fluopicolide)、氟菌胺、磺菌胺、三乙膦酸铝、三乙膦酸钙、三乙膦酸钠、六氯苯、伊鲁霉素(irumamycin)、异噻菌胺(isotianil)、磺菌威、(2E)-2-{2-[(环丙基[(4-甲氧基苯基)亚氨基]甲基]硫代)甲基]苯基}-3-甲氧基丙烯酸甲酯、异硫氰酸甲酯、苯菌酮(metrafenone)、(5-溴-2-甲氧基-4-甲基吡啶-3-基)(2,3,4-三甲氧基-6-甲基苯基)甲酮、米多霉素、甲磺菌胺(tolnifanide)、N-(4-氯苄基)-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧)苯基]丙酰胺、N-[(4-氯苄基)(氰基)甲基]-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧)苯基]丙酰胺、N-[(5-溴-3-氯吡啶-2-基)甲基]-2,4-二氯吡啶-3-羧酰胺、N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯吡啶-3-羧酰胺、N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2-氟-4-碘吡啶-3-羧酰胺、N-[(Z)-[(环丙基甲氧基)亚氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基]-2-苯基乙酰胺、N-[(E)-[(环丙基甲氧基)亚氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基]-2-苯基乙酰胺、多马霉素、二甲基二硫代氨基甲

酸镍、酞菌酯、辛噻酮、氧莫卡比(oxamocarb)、氧芬森(oxyfenthiin)、五氯苯酚及其盐、吩嗪-1-羧酸、苯醚菊酯、亚磷酸及其盐、霜霉威三乙膦酸盐、丙醇菌素(propanosine)-钠、丙氧喹啉(proquinazid)、硝吡咯菌素、五氯硝基苯、S-丙-2-烯-1-基-5-氨基-2-(1-甲基乙基)-4-(2-甲基苯基)-3-氧-2,3-二氢-1H-吡唑-1-硫羧酸酯、叶枯酞、四氯硝基苯、咪唑嗪、水杨菌胺、5-氯-N'-苯基-N'-丙-2-炔-1-基噻吩-2-磺酰肼以及氰菌胺。

[0164] 包含式(I)化合物与杀细菌剂化合物的混合物的本发明组合物也是特别有益的。合适的杀细菌剂混合伴侣的例子可以选自下组：溴硝醇、双氯酚、氯定、福美镍、春雷霉素、辛噻酮、呋喃羧酸、土霉素、噻菌灵、链霉素、叶枯酞、硫酸铜、以及其它铜制剂。

[0165] 根据本发明的式(I)化合物与杀真菌剂组合物可以用来治疗性地或者预防性地控制植物或农作物的植物病原真菌。

[0166] 因此,根据本发明的又一个方面,提供一种治疗性地或者预防性地控制植物或作物的植物病原真菌的方法,这种方法的特征在于将本发明的式(I)的化合物或者杀真菌剂组合物施用于种子、植物或植物的果实、或者正在生长或需要生长植物的土壤中。

[0167] 根据本发明的处理方法还可用于处理繁殖材料如块茎或根茎等,并且可用于处理种子、幼苗或移植(pricking out)苗以及植物或移植植物。该处理方法也可用于处理根。本发明的处理方法也可用于处理植物的地上部分如有关植物的干、茎或梗、叶、花和果实。

[0168] 在可以或能够用本发明的方法予以保护的植物当中,可以一提的有棉花、亚麻、蔓生作物、果树或蔬菜,如蔷薇科植物(例如仁果如苹果和梨,而且还有核果如杏、杏仁和桃子)、Ribesioideae sp., Juglandaceae sp., Betulaceae sp., Anacardiaceae sp., Fagaceae sp., Moraceae sp., Oleaceae sp., Actinidaceae sp., Lauraceae sp., Musaceae sp. (例如香蕉树和plantains), Rubiaceae sp., Theaceae sp., Sterculiaceae sp., Rutaceae sp. (例如柠檬、橙子和葡萄); Solanaceae sp. (例如番茄), Liliaceae sp., Asteraceae sp. (例如 莴苣), Umbelliferae sp., Cruciferae sp., Chenopodiaceae sp., Cucurbitaceae sp., Papilionaceae sp. (例如豌豆), Rosaceae sp. (例如草莓); 主要作物如 Graminae sp. (例如玉蜀黍、草坪或谷物如小麦、黑麦、水稻、大麦和黑小麦), Asteraceae sp. (例如向日葵), 十字花科植物(例如油菜), Fabaceae sp. (例如花生), Papilionaceae sp. (例如大豆), Solanaceae sp. (例如土豆), Chenopodiaceae sp. (例如甜菜根), Elaeis sp. (例如油棕榈); 园艺和林业作物; 以及这些作物的遗传修饰同系物。

[0169] 用根据本发明的方法可以控制的植物或作物病害中,可以一提的是:

[0170] • 白粉病,例如:

[0171] 例如由小麦白粉菌(*Blumeria graminis*)引起的白粉病(*Blumeria diseases*);

[0172] 例如由白叉丝单囊壳(*Podosphaera leucotricha*)引起的叉丝单囊壳属病(*Podosphaera diseases*);

[0173] 例如由苍耳单丝壳(*Sphaerotheca filiginea*)引起的单丝壳属病(*Sphaerotheca diseases*);

[0174] 例如由葡萄钩丝壳(*Uncinula necator*)引起的钩丝壳属病(*Uncinula diseases*);

[0175] • 锈病,例如:

[0176] 例如由赛宾锈菌(*Gymnosporangium sabiniae*)引起的胶锈属病

(Gymnosporangium) 锈病；

[0177] 例如由咖啡驼孢锈菌 (*Hemileia vastatrix*) 引起的驼孢锈病 (*Hemileia diseases*)；

[0178] 例如由豆薯层锈菌 (*Phakopsora pachyrhizi*) 和山马蝗层锈菌 (*Phakopsora meibomia*) 引起的层锈菌属病 (*Phakopsora diseases*)；

[0179] 例如由隐匿柄锈菌 (*Puccinia recondita*)、禾柄锈菌 (*Puccinia graminis*)、条形柄锈菌 (*Puccinia striiformis*) 引起的柄锈菌属病 (*Puccinia diseases*)；

[0180] 例如由疣顶单胞锈菌 (*Uromyces appendiculatus*) 引起的单胞锈菌属病 (*Uromyces diseases*)；

[0181] • 卵菌病 (*Oomycete diseases*), 例如：

[0182] 例如由白锈菌 (*Albugo candida*) 引起的白锈病 (*Albugo diseases*)；

[0183] 例如由苜蓿盘梗霉 (*Bremia lactucae*) 引起的盘梗霉属病 (*Bremia diseases*)；

[0184] 例如由豌豆霜霉 (*Peronospora pisi*) 和芸苔霜霉 (*Peronospora brassicae*) 引起的霜霉属病 (*Peronospora diseases*)；

[0185] 例如由致病疫霉 (*Phytophthora infestans*) 引起的疫霉属病 (*Phytophthora diseases*)；

[0186] 例如由葡萄生单轴霉 (*Plasmopara viticola*) 引起的单轴霉属病 (*Plasmopara diseases*)；

[0187] 例如由萆草霜霉 (*Pseudoperonospora humuli*) 和古巴假霜霉 (*Pseudoperonospora cubensis*) 引起的假霜霉属病 (*Pseudoperonospora diseases*)；

[0188] 例如由终极腐霉 (*Pythium ultimum*) 引起的腐霉属病 (*Pythium diseases*)；

[0189] • 叶斑病 (*Leafspot disease*)、污叶病 (*leaf blotch disease*) 和叶枯病 (*leaf blight disease*), 例如：

[0190] 例如由茄链格孢 (*Alternaria solani*) 引起的支链孢属病 (*Alternaria diseases*)；

[0191] 例如由甜菜生尾孢 (*Cercospora beticola*) 引起的尾孢霉属病 (*Cercospora diseases*)；

[0192] 例如由瓜枝孢 (*Cladosporium cucumerinum*) 引起的金孢子菌属病 (*Cladosporium diseases*)；

[0193] 例如由禾旋孢腔菌 (*Cochliobolus sativus*) (Conidiaform: *Drechslera*, Syn: 长蠕孢) 或官部旋孢腔菌 (*Cochliobolus miyabeanus*) 引起的旋孢腔菌病 (*Cochliobolus diseases*)；

[0194] 例如由豆刺盘孢 (*Colletotrichum lindemuthianum*) 引起的刺盘孢属病 (*Colletotrichum diseases*)；

[0195] 例如由油橄榄孔雀斑菌 (*Cycloconium oleaginum*) 引起的油橄榄孔雀斑病 (*Cycloconium*) 病；

[0196] 例如由柑桔间座壳 (*Diaporthe citri*) 引起的腐皮壳菌层病 (*Diaporthe diseases*)；

[0197] 例如由柑桔痂囊腔菌 (*Elsinoe fawcettii*) 引起的痂囊腔菌属病 (*Elsinoe*

diseases) ;

[0198] 例如由悦色盘长孢(*Gloeosporium laeticolor*)引起的长孢属病 (*Gloeosporium diseases*) ;

[0199] 例如由围小丛壳(*Glomerella cingulata*)引起的小丛壳属病 (*Glomerella diseases*) ;

[0200] 例如由葡萄球座菌(*Guignardia bidwellii*)引起的球座菌属病 (*Guignardia diseases*) ;

[0201] 例如由十字花科小球腔菌(*Leptosphaeria maculans*)和颖枯小球腔菌 (*Leptosphaeria nodorum*)引起的小球腔菌属病 (*Leptosphaeria diseases*) ;

[0202] 例如由稻瘟菌 (*Magnaporthe grisea*)引起的稻瘟病 (*Magnaporthe diseases*) ;

[0203] 例如由禾生球腔菌 (*Mycosphaerella graminicola*)、落花生球腔菌 (*Mycosphaerella arachidicola*)和香蕉黑条叶斑菌(*Mycosphaerella fijiensis*)引起的球腔菌属病 (*Mycosphaerella diseases*) ;

[0204] 例如由颖枯壳针孢(*Phaeosphaeria nodorum*)引起的壳针孢属病 (*Phaeosphaeria*) ;

[0205] 例如由圆核腔菌 (*Pyrenophora teres*)或偃麦草核腔菌 (*Pyrenophora tritici repentis*)引起的核腔菌属病 (*Pyrenophora diseases*) ;

[0206] 例如由辛加柱隔孢(*Ramularia collo-cygni*)或白斑柱隔孢 (*Ramularia areola*)引起的柱隔孢属病 (*Ramularia diseases*) ;

[0207] 例如由黑麦喙孢 (*Rhynchosporium secalis*)引起的喙孢属病 (*Rhynchosporium diseases*) ;

[0208] 例如由芹菜小壳针孢(*Septoria apii*)和番茄壳针孢 (*Septoria lycopersici*)引起的壳针孢属病 (*Septoria diseases*) ;

[0209] 例如由肉孢核瑚菌(*Thyphula incarnata*)引起的核瑚菌属病(*Typhula diseases*) ;

[0210] 例如由苹果黑星菌 (*Venturia inaequalis*)引起的黑星菌属病 (*Venturia diseases*) ;

[0211] • 根病、鞘病和茎病,例如:

[0212] 例如由禾伏革菌(*Corticium graminearum*)引起的伏革菌病 (*Corticium diseases*) ;

[0213] 例如由尖镰孢 (*Fusarium oxysporum*)引起的镰孢菌(霉)属病 (*Fusarium diseases*) ;

[0214] 例如由禾顶囊壳(*Gaeumannomyces graminis*)引起的鲟形属病 (*Gaeumannomyces diseases*) ;

[0215] 例如由立枯丝核菌 (*Rhizoctonia solani*)引起的丝核菌属病(*Rhizoctonia*)病;

[0216] 例如由稻帚枝霉(*Sarocladium oryzae*)引起的水稻叶鞘腐败病(*Sarocladium diseases*) ;

[0217] 例如由稻腐小核菌(*Sclerotium oryzae*)引起的小核菌病(*Sclerotium diseases*) ;

- [0218] 例如由塔普斯梭状芽胞杆菌(*Tapesia acuformis*)引起的塔普斯病(*Tapesia diseases*);
- [0219] 例如由根串珠霉(*Thielaviopsis basicola*)引起的根串珠霉属病(*Thielaviopsis diseases*);
- [0220] • 包括玉米穗轴(*Maize cob*)的耳穗和圆锥花序病,例如:
- [0221] 例如由链格孢(*Alternaria spp.*)引起的链格孢属病(*Alternaria diseases*);
- [0222] 例如由黄曲霉(*Aspergillus flavus*)引起的曲霉病(*Aspergillus diseases*);
- [0223] 例如由芽枝状枝孢(*Cladosporium cladosporioides*)引起的枝孢属病(*Cladosporium diseases*);
- [0224] 例如由麦角菌(*Claviceps purpurea*)引起的麦角菌属病(*Claviceps diseases*);
- [0225] 例如由大刀镰孢(*Fusarium culmorum*)引起的镰孢菌(霉)属病(*Fusarium diseases*);
- [0226] 例如由玉蜀黍赤霉(*Gibberella zeae*)引起的赤霉病(*Gibberella diseases*);
- [0227] 例如由水稻云形菌(*Monographella nivalis*)引起的水稻云形病(*Monographella diseases*);
- [0228] • 黑穗病和腥黑穗病,例如:
- [0229] 例如由丝轴黑粉菌(*Sphacelotheca reiliana*)引起的轴黑粉菌属病(*Sphacelotheca diseases*);
- [0230] 例如由小麦网腥黑粉菌(*Tilletia caries*)引起的腥黑粉菌属病(*Tilletia diseases*);
- [0231] 例如由隐条黑粉菌(*Urocystis occulta*)引起的条黑粉菌属病(*Urocystis diseases*);
- [0232] 例如由裸黑粉菌(*Ustilago nuda*)引起的黑粉菌属病(*Ustilago diseases*);
- [0233] • 果实腐烂和霉菌病,例如:
- [0234] 例如由黄曲霉(*Aspergillus flavus*)引起的曲霉病(*Aspergillus diseases*);
- [0235] 例如由灰葡萄孢(*Botrytis cinerea*)引起的葡萄孢属病(*Botrytis diseases*);
- [0236] 例如由甘薯青霉(*Penicillium expansum*)和紫青霉(*Penicillium purpurogenum*)引起的青霉菌病(*Penicillium diseases*);
- [0237] 例如由匍枝根霉(*Rhizopus stolonifer*)引起的根霉病(*Rhizopus*);
- [0238] 例如由核盘菌(*Sclerotinia sclerotiorum*)引起的核盘菌属病(*Sclerotinia diseases*);
- [0239] 例如由黑白轮枝孢(*Verticillium albo-atrum*)引起的轮枝孢属病(*Verticillium diseases*);
- [0240] • 种子和土壤传播的腐烂、霉菌、枯萎、腐败以及猝倒病
- [0241] 例如由芥链格孢(*Alternaria brassicicola*)引起的链格孢病(*Alternaria diseases*);
- [0242] 例如由丝囊霉(*Aphanomyces gordejevii*)丝囊霉病(*Aphanomyces diseases*);
- [0243] 例如由晶状体二胞菌(*Ascochyta lentis*)引起的壳二孢病(*Ascochyta*

diseases) ;

[0244] 例如由黄曲霉(*Aspergillus flavus*)引起的曲霉病(*Aspergillus diseases*) ;

[0245] 例如由多主枝孢(*Cladosporium herbarum*)引起的枝孢病(*Cladosporium diseases*) ;

[0246] 例如由禾旋孢腔菌(*Cochliobolus sativus*)引起的旋孢腔菌病(*Cochliobolus diseases*) ;

[0247] (Conidiaform:*Drechslera*,*Bipolaris* Syn:长蠕孢(*Helminthosporium*));

[0248] 例如由粒状体刺盘孢(*Colletotrichum coccodes*)引起的刺盘孢病(*Colletotrichum diseases*) ;

[0249] 例如由大刀镰孢(*Fusarium culmorum*)引起的镰孢菌(霉)属病(*Fusarium diseases*) ;

[0250] 例如由玉蜀黍赤霉(*Gibberella zeae*)引起的赤霉病(*Gibberella diseases*) ;

[0251] 例如由豆类壳球孢(*Macrophomina phaseolina*)引起的壳球孢病(*Macrophomina diseases*) ;

[0252] 例如由雪腐小托菌(*Microdochium nivale*)引起的小托菌病(*Microdochium diseases*) ;

[0253] 例如由水稻云形菌(*Monographella nivalis*)引起的水稻云形病(*Monographella diseases*) ;

[0254] 例如由甘薯青霉(*Penicillium expansum*)引起的青霉病(*Penicillium diseases*) ;

[0255] 例如由黑胫茎点霉(*Phoma lingam*)引起的茎点霉病(*Phoma diseases*) ;

[0256] 例如由大豆茎点霉(*Phomopsis sojae*)引起的茎点霉病(*Phomopsis diseases*) ;

[0257] 例如由恶疫霉(*Phytophthora cactorum*)引起的疫霉属病(*Phytophthora diseases*) ;

[0258] 例如由麦类核腔菌(*Pyrenophora graminea*)引起的核腔菌病(*Pyrenophora diseases*) ;

[0259] 例如由稻梨孢(*Pyricularia oryzae*)引起的稻热病(*Pyricularia diseases*) ;

[0260] 例如由终极腐霉(*Pythium ultimum*)引起的腐霉属病(*Pythium diseases*) ;

[0261] 例如由立枯丝核菌(*Rhizoctonia solani*)引起的丝核菌属病(*Rhizoctonia*)病 ;

[0262] 例如由米根霉(*Rhizopus oryzae*)引起的根霉病(*Rhizopus diseases*) ;

[0263] 例如由齐整小核菌(*Sclerotium rolfsii*)引起的小核菌病(*Sclerotium diseases*) ;

[0264] 例如由颖枯壳针孢(*Septoria nodorum*)引起的壳针孢病(*Septoria diseases*) ;

[0265] 例如由肉色核瑚菌(*Typhula incarnata*)引起的核瑚菌病(*Typhula diseases*) ;

[0266] 例如由大丽花轮枝孢(*Verticillium dahliae*)引起的轮枝孢病(*Verticillium diseases*) ;

[0267] • 蛀孔病(Canker)、松碎(Broom)和梢枯病,例如 :

[0268] 例如由干癌丛赤壳菌(*Nectria galligena*)引起的丛赤壳属病(*Nectria diseases*) ;

- [0269] • 枯萎病,例如:
- [0270] 例如由核果链核盘菌 (*Monilinia laxa*) 引起的链核盘菌属病 (*Monilinia diseases*);
- [0271] • 包括花和果实变形在内的叶疱病或卷叶病,例如:
- [0272] 例如由坏损外担子菌 (*Exobasidium vexans*) 引起的外担子菌病 (*Exobasidium diseases*);
- [0273] 例如由畸形外囊菌 (*Taphrina deformans*) 引起的外囊菌属病 (*Taphrinadiseases*);
- [0274] • 木植物衰退病,例如:
- [0275] 例如由根霉格孢菌 (*Phaeoconiella clamydospora*)、*Phaeoacremonium aleophilum* 和 *Fomitiporia mediterranea* 引起的依科病 (*Esca diseases*);
- [0276] 例如由 *Ganoderma boninense* 引起的灵芝病 (*Ganoderma diseases*);
- [0277] • 花和种子的疾病,例如:
- [0278] 例如有灰葡萄孢 (*Botrytis cinerea*) 引起的葡萄孢属病 (*Botrytis diseases*);
- [0279] • 根茎病,例如:
- [0280] 例如由立枯丝核菌 (*Rhizoctonia solani*) 引起的丝核菌属病 (*Rhizoctonia*) 病;
- [0281] 例如由立枯长蠕孢 (*Helminthosporium solani*) 引起的长蠕孢菌属病 (*Helminthosporium diseases*);
- [0282] • 根肿病,例如:
- [0283] 例如由芸苔根肿菌 (*Plasmodiophora brassicae*) 引起的根肿菌病 (*Plasmodiophora diseases*);
- [0284] • 由细菌微生物引起的病,例如:
- [0285] 例如由野油菜黄单胞菌水稻致病变种 (*Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*) 引起的黄单胞菌病;
- [0286] 例如由丁香假单胞菌黄瓜致病变种 (*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*) 引起的假单胞菌病;
- [0287] 例如由解淀粉欧文氏菌 (*Erwinia amylovora*) 引起的欧文氏菌病。
- [0288] 本发明的杀真菌剂组合物还可以用来抵抗易于在木材上或木材内部生长的真菌病。术语“木材”是指所有类型的木材、以及对该木材进行加工用于建筑业的所有类型的加工材料,例如实木、高密度木材、层压木材和胶合板。本发明的木材处理方法主要包括:使木材与本发明的一种或多种化合物、或者本发明的组合物接触;这包括例如直接施用、喷雾、浸涂、注射或任意其它方式。
- [0289] 在依据本发明的处理方法中,对于应用于叶处理时,活性化合物通常施用的剂量有利地是 10 到 800 克/公顷,优选 50 到 300 克/公顷。对用于种子处理,活性物质的施用剂量通常有利地是 2-200 克/100 千克种子,优选 3-150 克/100 千克种子。
- [0290] 应该清楚地理解,这里所示的剂量仅仅是作为本发明方法的说明性示例。本领域技术人员知道如何调整施用剂量,尤其是依据要处理的植物或作物的性质调整施用剂量。
- [0291] 本发明的杀真菌组合物还可以用于处理用本发明的化合物或者本发明的农用化学组合物对遗传修饰的生物体。所谓遗传修饰的植物是其基因组已被稳定地整合入编码相

关蛋白质的异源基因的植物。“编码相关的蛋白质的异源基因”主要是指赋予转化植物新的农学性质的基因,或者改善修饰植物的农学性质的基因。

[0292] 本发明的化合物或者混合物还可以用于制备对于治疗性或预防性地处理人及动物真菌疾病的组合物,这些疾病例如霉菌病 (mycose)、皮肤病、癣菌病、念珠菌病、或由曲霉属 (*Aspergillus* spp.) 如烟曲霉 (*Aspergillus fumigatus*) 引起的曲霉病。

[0293] 现在参照下表的化合物实施例以及以下的制备实施例对本发明的各个方面予以说明。

[0294] 下表以非限制性的方式对依据本发明的化合物予以说明。

[0295] 在下表中, $M+H$ (或 $M-H$) 分别是质谱中的分子离子峰加 1 a. m. u 或减 1 a. m. u (原子质量单位), $M(ApcI+)$ 是指质谱中通过正压化学电离得到的分子离子峰。

[0296] 下表中, $\log P$ 是依据 EEC 指令 79/831 附录 V. A8 (EEC Directive 79/831 Annex V. A8) 用 HPLC 法 (高效液液体色谱) 在逆向柱 (C18) 上测定的, 方法如下:

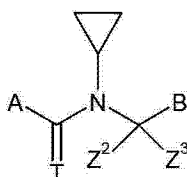
[0297] 温度: $40^{\circ} C$; 移动相: 0.1% 甲酸和乙腈水溶液; 线性梯度从 10% 乙腈到 90% 乙腈。

[0298] 用 $\log P$ 值已知的无支链烷-2-酮 (包含 3-16 个碳原子) 进行校准 (通过在两个相继的烷酮之间使用线性内插法确定 $\log P$ 值)。

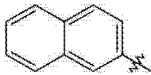
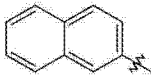
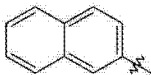
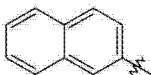
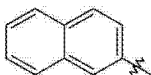
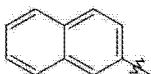
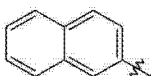
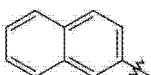
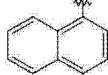
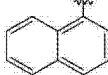
[0299] 使用 190 纳米到 400 纳米的紫外光谱, 在色谱信号最大值处确定 λ 最大值。

[0300] 以下实施例以非限制性的方式对依据本发明的式 (I) 化合物的制备予以说明。

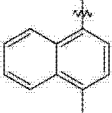
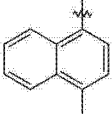
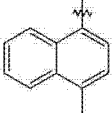
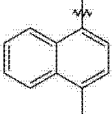
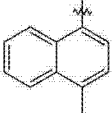
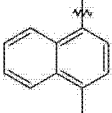
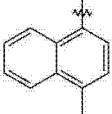
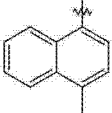
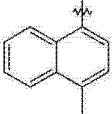
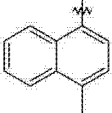
[0301]



[0302]

Ex. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
1	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			338
2	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			352
3	A5	N-Me	Me	-	F	S	H	H			354
4	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			368
5	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			356
6	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			370
7	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			336
8	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H			350
9	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			352
10	A5	N-Me	Me	-	F	S	H	H			368

[0303]

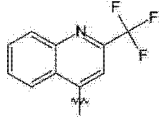
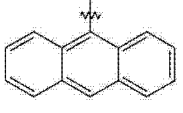
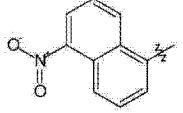
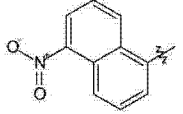
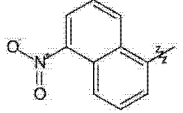
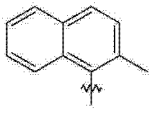
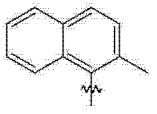
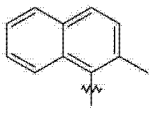
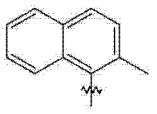
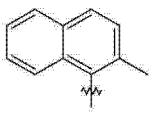
实施例	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
11	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			370
12	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			384
13	A2	N-Me	H	H	H	O	Me	H			333
14	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H			348
15	A2	S	Me	H	H	O	Me	H			350
16	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			366
17	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			350
18	A5	N-Me	CF3	-	F	O	Me	H			420
19	A1	O	Me	H	H	O	Me	H			334
20	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H			364

[0304]

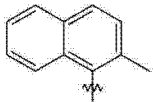
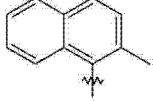
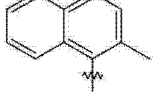
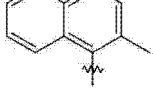
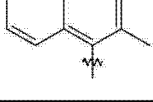
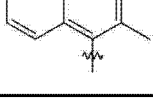
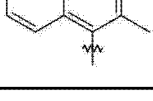
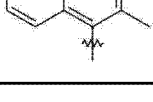
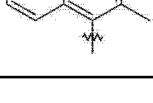
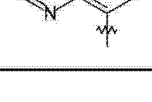
实施例	A	V ¹	R ²	R ³	R ⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
21	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	Me	H			401
22	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
23	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			357
24	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			416
25	A5	N-Me	Me	-	F	S	H	H			4,39
26	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			3,68
27	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			3,24
28	A5	N-Me	OMe	-	H	S	H	H			4,25
29	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			407
30	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			421

[0305]

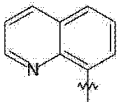
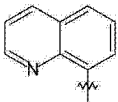
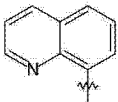
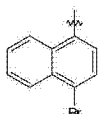
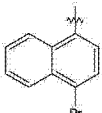
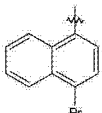
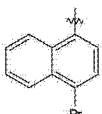
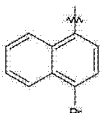
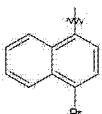
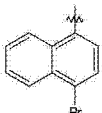
实施例

Ex. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
31	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			425
32	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			406
33	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			383
34	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			401
35	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			381
36	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			352
37	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			
38	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			
39	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			
40	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H		3,25	

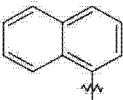
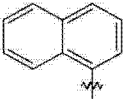
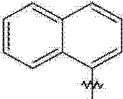
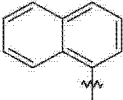
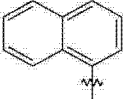
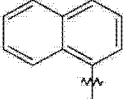
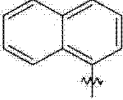
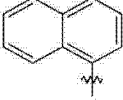
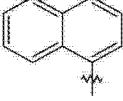
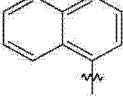
[0306]

实施例	A	V ¹	R ²²	R ²³	R ²⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
41	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			350
42	A5	N-Me	OMe	-	H	S	H	H			366
43	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H			
44	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			319
45	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			334
46	A2	S	Me	H	H	O	H	H			336
47	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			406
48	A1	O	Me	H	H	O	H	H			320
49	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			387
50	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339

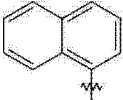
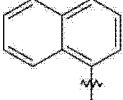
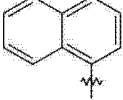
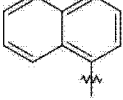
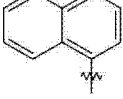
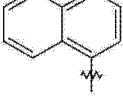
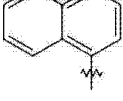
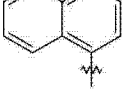
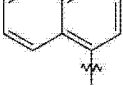
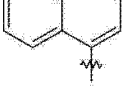
[0307]

实施例	A	V ¹	R ²²	R ²³	R ²⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
51	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			357
52	A5	N-Me	CHF2	-	H	S	H	H			373
53	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			337
54	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		3,62	
55	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H		3,69	
56	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H		414	
57	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H		430	
58	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H		444	
59	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H		448	
60	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H		5,2	

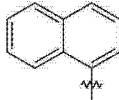
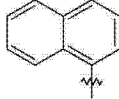
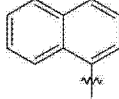
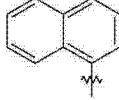
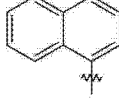
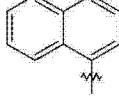
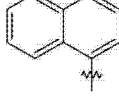
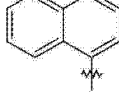
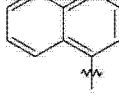
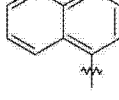
[0308]

实施例	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
61	A5	N-Me	CF ₃	-	H	O	COOMe	H			432
62	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	COOMe	H			431
63	A5	N-Me	Me	-	F	O	COOMe	H		2,92	
64	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			338
65	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			352
66	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			368
67	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			366
68	A5	N-Me	Et	-	F	S	Me	H			382
69	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	COOMe	H		3,02	
70	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			356

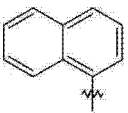
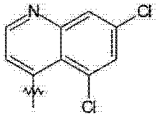
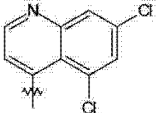
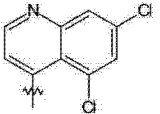
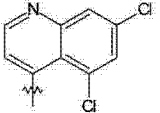
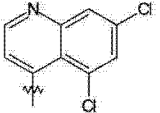
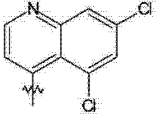
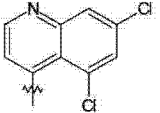
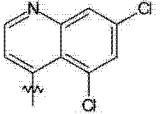
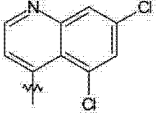
[0309]

实施例	A	V ¹	R ²²	R ²³	R ²⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
71	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			370
72	A5	N-Me	CHF2	-	H	S	H	H			372
73	A5	N-Me	OMe	-	H	O	COOMe	H			394
74	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			336
75	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H		2,86	
76	A2	N-Me	H	H	H	O	Me	H			319
77	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H			334
78	A2	S	Me	H	H	O	Me	H			336
79	A5	N-Me	CF3	-	F	O	Me	H			406
80	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			

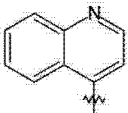
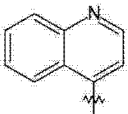
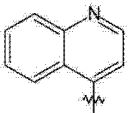
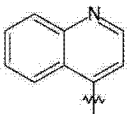
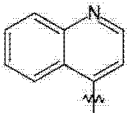
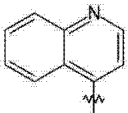
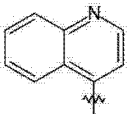
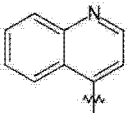
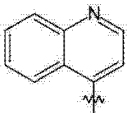
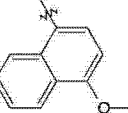
[0310]

实施例	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
81	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			
82	A1	N-Me	H	CHF2	H	O	Me	H			369
83	A5	N-Me	Me	-	F	O	Et	H			366
84	A1	O	Me	H	H	O	Me	H			320
85	A5	N-Me	Et	-	F	O	Et	H			380
86	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Et	H			384
87	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			
88	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			
89	A5	N-Me	CHF2	-	F	O	Me	H			388
90	A1	N-Me	H	CF3	H	O	Me	H			387

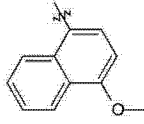
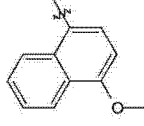
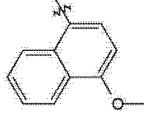
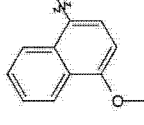
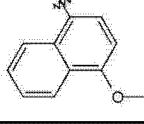
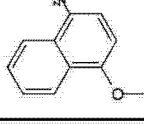
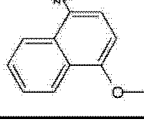
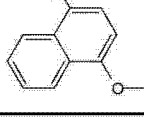
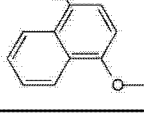
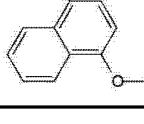
[0311]

实施例	A	V ¹	R ²²	R ²³	R ²⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
91	A5	N-Me	CF ₂ Me	-	H	O	Me	H			384
92	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			405
93	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			374
94	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			389
95	A2	S	Me	H	H	O	H	H			391
96	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			461
97	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			407
98	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			425
99	A1	O	Me	H	H	O	H	H			375
100	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			442

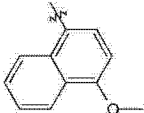
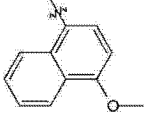
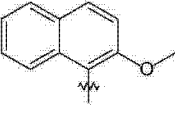
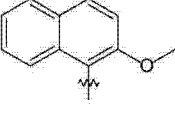
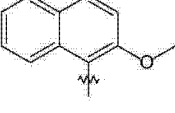
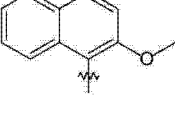
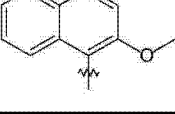
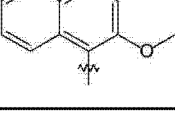
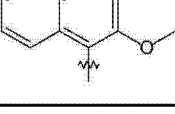
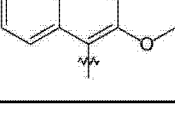
[0312]

实施例	A	V ¹	R ²²	R ²³	R ²⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
101	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			337
102	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			306
103	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			321
104	A2	S	Me	H	H	O	H	H			323
105	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			393
106	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
107	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			357
108	A1	O	Me	H	H	O	H	H			307
109	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			374
110	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			366

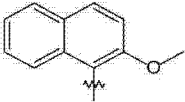
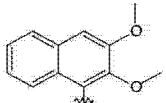
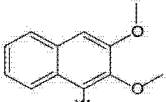
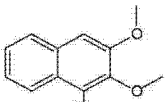
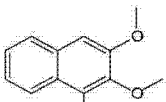
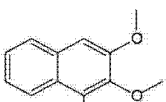
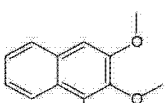
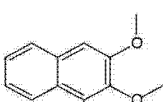
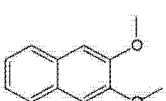
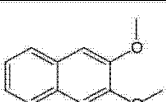
[0313]

实施例	A	V ¹	R ²	R ³	R ⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
111	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			335
112	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			350
113	A2	S	Me	H	H	O	H	H			352
114	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			422
115	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			368
116	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			386
117	A1	O	Me	H	H	O	H	H			336
118	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			403
119	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			382
120	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			396

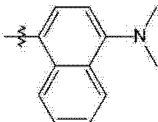
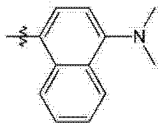
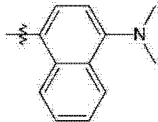
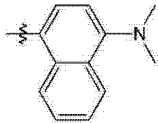
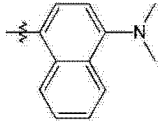
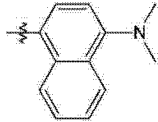
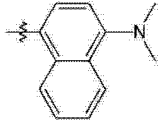
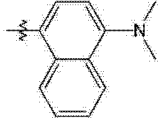
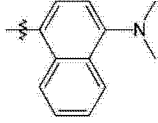
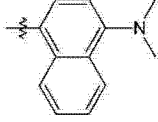
[0314]

实施例	A	V ¹	R ⁰²	R ⁰³	R ⁰⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
121	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			400
122	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H			364
123	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			366
124	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			335
125	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			350
126	A2	S	Me	H	H	O	H	H			352
127	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			422
128	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			368
129	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			386
130	A1	O	Me	H	H	O	H	H			336

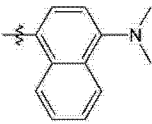
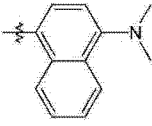
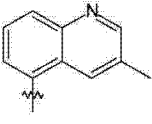
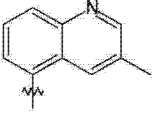
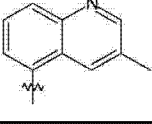
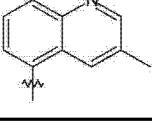
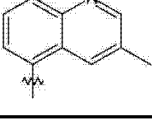
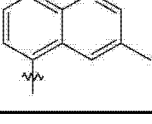
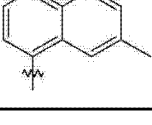
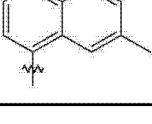
[0315]

实施例	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
131	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			403
132	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			396
133	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			365
134	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			380
135	A2	S	Me	H	H	O	H	H			382
136	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			452
137	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			398
138	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			416
139	A1	O	Me	H	H	O	H	H			366
140	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			433

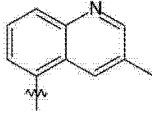
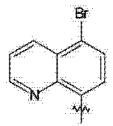
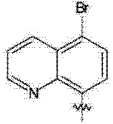
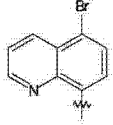
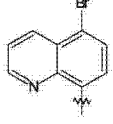
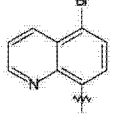
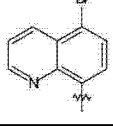
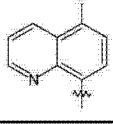
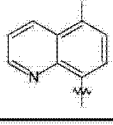
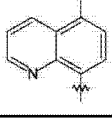
[0316]

实施例	A	V ¹	R ²²	R ²³	R ²⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
141	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			379
142	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			348
143	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			363
144	A2	S	Me	H	H	O	H	H			365
145	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			435
146	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			381
147	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			399
148	A1	O	Me	H	H	O	H	H			349
149	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			416
150	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			395

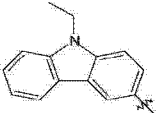
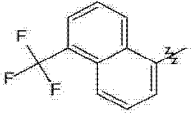
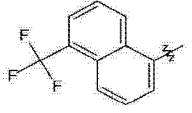
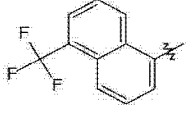
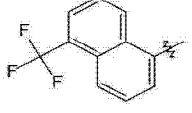
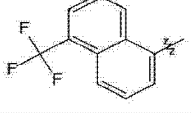
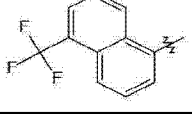
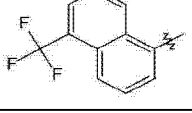
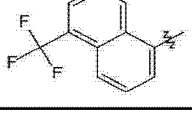
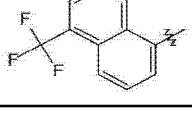
[0317]

实施例	A	V ¹	R ²²	R ²³	R ²⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
151	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			409
152	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			413
153	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			351
154	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			320
155	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			335
156	A2	S	Me	H	H	O	H	H			337
157	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			407
158	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			353
159	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			371
160	A1	O	Me	H	H	O	H	H			321

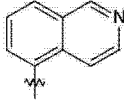
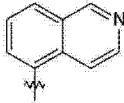
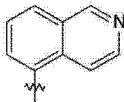
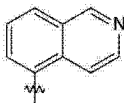
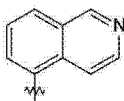
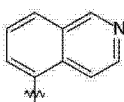
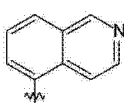
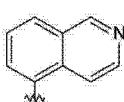
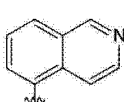
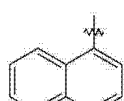
[0318]

实施例	A	V ¹	R ²	R ³	R ⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
161	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			388
162	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			415
163	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			384
164	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			399
165	A2	S	Me	H	H	O	H	H			401
166	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			471
167	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		2,9	
168	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			435
169	A1	O	Me	H	H	O	H	H			385
170	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			452

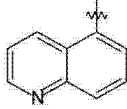
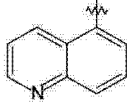
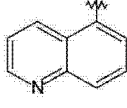
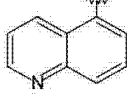
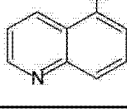
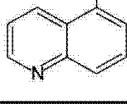
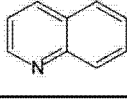
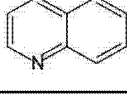
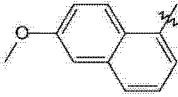
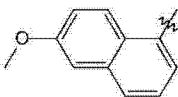
[0319]

实施例	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
171	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			405
172	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			404
173	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			373
174	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			388
175	A2	S	Me	H	H	O	H	H			390
176	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			460
177	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			406
178	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			424
179	A1	O	Me	H	H	O	H	H			374
180	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			441

[0320]

实施例	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
181	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			337
182	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			306
183	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			321
184	A2	S	Me	H	H	O	H	H			323
185	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			393
186	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
187	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			357
188	A1	O	Me	H	H	O	H	H			307
189	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			374
190	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			337

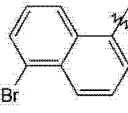
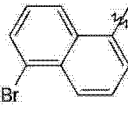
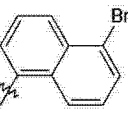
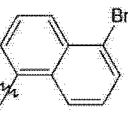
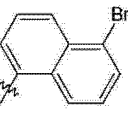
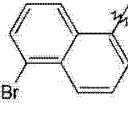
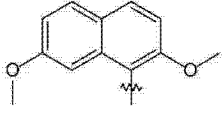
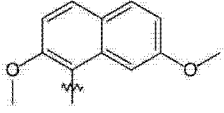
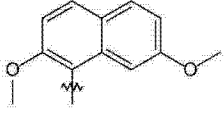
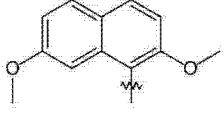
[0321]

实施例	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
191	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			306
192	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			321
193	A2	S	Me	H	H	O	H	H			323
194	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			393
195	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
196	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			357
197	A1	O	Me	H	H	O	H	H			307
198	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			374
199	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			366
200	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			335

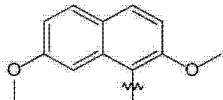
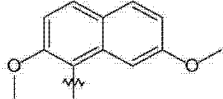
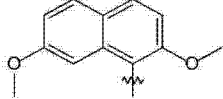
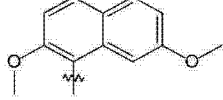
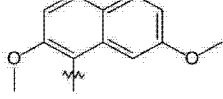
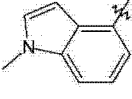
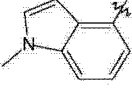
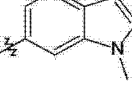
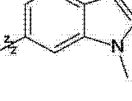
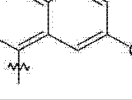
[0322]

实施例	A	V ¹	R ²²	R ²³	R ²⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
201	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			350
202	A2	S	Me	H	H	O	H	H			352
203	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			422
204	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			368
205	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			386
206	A1	O	Me	H	H	O	H	H			336
207	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			403
208	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			414
209	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			383
210	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			398

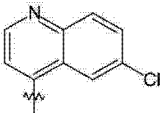
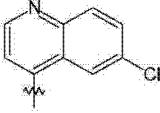
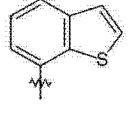
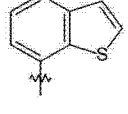
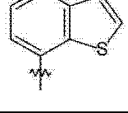
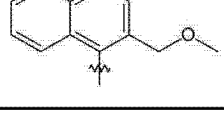
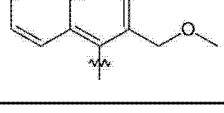
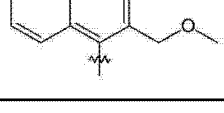
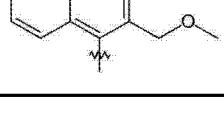
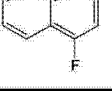
[0323]

实施例	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
211	A2	S	Me	H	H	O	H	H			400
212	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			470
213	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			416
214	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			434
215	A1	O	Me	H	H	O	H	H			384
216	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			451
217	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			396
218	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			365
219	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			380
220	A2	S	Me	H	H	O	H	H			382

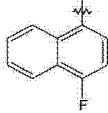
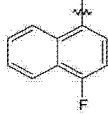
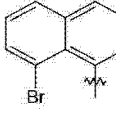
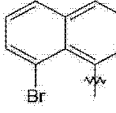
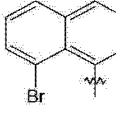
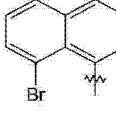
[0324]

实施例	A	V ¹	R ⁰²	R ⁰³	R ⁰⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
221	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			452
222	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		2,96	
223	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			416
224	A1	O	Me	H	H	O	H	H			366
225	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			433
226	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			341
227	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			359
228	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			341
229	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			359
230	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			373

[0325]

实施例	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
231	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			387
232	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			355
233	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			344
234	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			358
235	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			362
236	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			382
237	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			396
238	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			400
239	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			364
240	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			370

[0326]

实施例	A	V ¹	R ²	R ³	R ⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
241	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			388
242	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			384
243	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			416
244	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			430
245	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			434
246	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			398

[0327] 通用制备实施例 1:用 Optimizer™微波设备制备式 (I) 的酰胺衍生物

[0328] 在一个 8 毫升的 Optimizer™小瓶中称量 1.7 毫摩尔的胺 (II)。加入 2 毫升 1M 酰氯 (III) (2 毫摩尔) 的乙腈溶液, 然后加入 1 毫升三乙胺。将该小瓶密封, 在环境温度下预搅拌 10 秒钟, 然后在 180°C 微波加热 60 秒钟。冷却后将小瓶打开, 倒入 10 毫升的碳酸钾饱和溶液中。水层用 5 毫升二氯甲烷萃取两次。有机相用硫酸镁干燥。去除溶剂, 采用 LCMS 和 NMR 对粗制酰胺进行分析。纯度不够的化合物通过制备型 LCMS 进一步纯化。

[0329] 通用制备实施例 2:用 Chemspeed™设备对式 (I) 的酰胺衍生物进行硫化 (thionation)

[0330] 在一个 13 毫升的 Chemspeed™小瓶中称量 0.27 毫摩尔的五硫化二磷 (P₂S₅)。加入 3 毫升 0.18M 酰胺 (I) (0.54 毫摩尔) 的二噁烷溶液, 将该混合物回流加热 2 小时。然后将温度冷却至 80°C, 并加入 2.5 毫升水。于 80°C 加热该混合物 1 小时以上。然后加入 2 毫升水, 用 4 毫升二氯甲烷萃取反应混合物 2 次。将有机相置于碱式氧化铝筒 (basic alumina cartridge) (2 克) 中并用 8 毫升二氯甲烷洗脱两次。去除溶剂, 用 LCMS 和 NMR 对粗制硫代酰胺进行分析。纯度不够的化合物通过制备性 LCMS 进一步纯化。

[0331] 功效实施例 A:圆核腔菌 (Pyrenophora teres) (大麦网斑病) 的体内预防测试

[0332] 测试用的活性组分通过以下步骤制备:在丙酮/吐温/MDSO 混合物中均化, 然后用水稀释, 获得所需的活性材料浓度。

[0333] 将大麦植物 (Express 品种) 在起始杯中播种到 50/50 泥炭土-火山灰培养基中, 并在 12°C 生长, 在 1-叶阶段 (10 厘米高), 通过喷洒上述方法制备的活性组分来处理该植

物。用不含有活性材料的丙酮 / 吐温 / DMSO / 水混合物处理植物作为对照。

[0334] 在 24 小时之后, 通过些植物喷洒圆核腔菌孢子的水性悬浮液 (12000 个孢子 / 毫升) 而使它们受到污染。这些孢子收集自 15 天龄的培养物。污染的大麦植物在约 20° C 和 100% 相对湿度的条件下培养 24 小时, 然后在 80% 的相对湿度下培养 12 天。

[0335] 在污染后 12 天, 与对照植物相比较进行分级。

[0336] 在这些条件下, 使用 500ppm 剂量的以下化合物观察到良好的 (至少 70%) 或完全的保护 : 1, 2, 3, 6, 8, 9, 11, 12, 16, 18, 24, 25, 26, 27, 33, 36, 40, 42, 47, 50, 54, 55, 57, 58, 59, 64, 65, 66, 67, 69, 71, 72, 75, 79, 80, 81, 82, 83, 85, 86, 87, 88, 89, 100, 109, 116, 119, 120, 145, 149, 166, 167, 168, 176, 177, 178, 204, 213, 214, 222, 226, 227, 228, 240, 241 和 242。

[0337] 功效实施例 B : 对苍耳单丝壳 (*Sphaerotheca fuliginea*) (葫芦霉粉病) 的体内预防测试

[0338] 测试用的活性组分通过以下步骤制备 : 在丙酮 / 吐温 / MDSO 混合物中均化, 然后用水稀释, 获得所需的活性材料浓度。

[0339] 将小黄瓜植物 (Vert petit de Paris 种) 放置在起始杯中, 种植到 50/50 泥炭土 - 火山灰培养基中, 并在 20° C / 23° C 生长, 在头两叶阶段通过喷洒上述水性悬浮液处理该植物。用不含有活性材料的丙酮 / 吐温 / DMSO / 水混合物处理植物作为对照。

[0340] 在 24 小时之后, 通过向植物喷洒苍耳单丝壳孢子水性悬浮液 (100000 个孢子 / 毫升) 将植物污染。这些孢子收集自受污染的植物。受污染的小黄瓜植物在 20° C / 25° C 和 60/70% 相对湿度的条件下培养。

[0341] 在污染后 11-12 天, 与对照植物相比较进行分级 (功效百分数)。

[0342] 在这些条件下, 使用 500ppm 剂量的以下化合物观察到良好的 (至少 70%) 或完全的保护 : 2, 6, 8, 11, 12, 17, 18, 22, 23, 25, 26, 36, 40, 41, 42, 47, 49, 50, 51, 53, 55, 56, 57, 58, 59, 63, 64, 65, 66, 67, 69, 70, 71, 72, 74, 75, 79, 80, 81, 82, 83, 85, 86, 87, 88, 89, 100, 105, 109, 120, 128, 129, 136, 137, 138, 149, 157, 158, 159, 166, 167, 168, 176, 177, 178, 180, 185, 194, 195, 196, 198, 204, 205, 221, 222, 240, 241 和 242。

[0343] 功效实施例 C : 对禾生球腔菌 (*Mycosphaerella graminicola*) (小麦叶斑枯病) 的体内预防测试

[0344] 测试用的活性成分通过以下步骤制备 : 在丙酮 / 吐温 / MDSO 混合物中均化, 然后用水稀释, 获得所需的活性材料浓度。

[0345] 将小麦植物 (Scipion 品种) 在起始杯中播种到 50/50 泥炭土 - 火山灰培养基中, 并在 12° C 生长, 在 1-叶阶段 (10 厘米高), 通过喷洒上述方法制备的活性成分来处理该植物。

[0346] 用不含有活性材料的丙酮 / 吐温 / DMSO / 水混合物处理植物作为对照。

[0347] 在 24 小时之后, 通过向植物喷洒禾生球腔菌孢子的水性悬浮液 (500000 个孢子 / 毫升) 将植物污染。孢子收集自 7 天龄的培养物。污染后的小麦植物在约 18° C 和 100% 相对湿度的条件下培养 72 小时, 然后在 90% 的相对湿度培养 21 到 28 天。

[0348] 在污染后 21 到 28 天, 与对照植物相比较进行分级 (% 功效)。

[0349] 在这些条件下, 使用 500ppm 剂量的以下化合物观察到良好的 (至少 70%) 或完全的保护 : 1, 2, 5, 6, 7, 8, 9, 11, 17, 18, 22, 23, 24, 26, 27, 32, 33, 34, 36, 40, 41, 47, 48, 49, 50, 51

, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 63, 64, 65, 67, 69, 70, 71, 74, 75, 79, 80, 81, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 94, 96, 97, 100, 105, 109, 115, 116, 119, 120, 128, 129, 134, 136, 137, 138, 140, 145, 146, 147, 149, 155, 157, 158, 161, 164, 166, 167, 168, 170, 172, 174, 176, 177, 178, 180, 183, 185, 186, 187, 190, 192, 194, 195, 221, 225, 226, 227, 228, 229, 240, 241 和 242。

[0350] 功效实施例 D:对隐匿柄锈菌(Puccinia recondita f. Sp. tritici) (小麦褐锈病) 的体内测试

[0351] 测试用的活性组分通过以下步骤制备:在丙酮/吐温/MDSO混合物中均化,然后用水稀释,获得所需的活性材料浓度。

[0352] 将小麦植物(Scipion品种)在起始杯中播种到50/50泥炭土-火山灰培养基中,并在12°C生长,在1-叶阶段(10厘米高),通过喷洒上述方法制备的活性成分来处理该植物。用不含有活性材料的丙酮/吐温/DMSO/水混合物处理植物作为对照。

[0353] 在24小时之后,通过向植物叶子喷洒隐匿柄锈菌孢子水性悬浮液(100000个孢子/毫升)将植物污染。这些孢子收集自10天龄的受污染小麦,并悬浮在含2.5毫升/升的10%的吐温80的水中。污染后的小麦植物在约20°C和100%相对湿度的条件下培养24小时,然后在20°C和70%的相对湿度度培养10天。在污染后10天,与对照植物相比较进行分级。

[0354] 在这些条件下,使用500ppm剂量的以下化合物观察到良好的(至少70%)或完全的保护:1, 2, 9, 16, 24, 25, 26, 36, 47, 49, 54, 57, 58, 63, 64, 65, 66, 67, 80, 83, 85, 87, 88, 89, 94, 100, 109, 119, 120, 134, 136, 137, 138, 140, 149, 158, 167, 176, 177, 178, 240 和 242。

[0355] 实施例 E:对芸苔链格孢(Alternaria brassicae) (十字花科植物叶枯病) 的体内测试

[0356] 测试用的活性组分通过以下步骤制备:在丙酮/吐温/MDSO混合物中均化,然后用水稀释,获得所需的活性材料。

[0357] 将小红萝卜植物(Pernot种)在起始杯中播种到50/50泥炭土-火山灰培养基中,并在18-20°C生长,在子叶阶段,通过喷洒上述方法制备的活性组分来处理该植物。

[0358] 用不含活性材料的丙酮/吐温/水混合物处理植物,作为对照。

[0359] 在24小时之后,通过向植物喷洒芸苔链格(Alternaria brassicae)孢子水性悬浮液(40000个孢子/厘米³)将植物污染。这些孢子收集自12到13天龄的培养物。

[0360] 受污染的小红萝卜植物在约18°C和潮湿氛围中培养6到7天。

[0361] 在污染后6到7天,与对照植物相比较进行分级。

[0362] 在这些条件下,使用500ppm剂量的以下化合物观察到良好的(至少70%)保护:2, 6, 12, 16, 18, 26, 47, 49, 57, 65, 66, 67, 69, 79, 80, 83, 166, 167, 176, 204, 213, 214 和 240。

[0363] 实施例 F:对灰葡萄孢(Botrytis cinerea) (灰霉) 的体内测试

[0364] 测试用的活性组分通过以下步骤制备:在丙酮/吐温/MDSO混合物中均化,然后用水稀释,获得所需的活性材料。

[0365] 将小黄瓜植物(Vert petit de Paris种)放置在起始杯中,种植到50/50泥炭土-火山灰培养基中,并在18-20°C生长,在子叶Z11阶段,通过向植物喷洒上述方法制备的活性组分来处理该植物。

[0366] 用不含活性材料的水溶液处理植物,作为对照。

[0367] 24 小时之后,通过在植物叶子上表面滴上灰葡萄孢子的水性悬浮液(150000 个孢子 / 毫升)将植物污染。这些孢子收集自 15 天龄的培养物,并悬浮于如下组分组成的营养液中:

[0368] -20g/L 的明胶;

[0369] -50g/L 的 D- 果糖;

[0370] -2g/L 的 NH_4NO_3 ;

[0371] -1g/L 的 KH_2PO_4 。

[0372] 受污染的黄瓜植物在气候室中在 15-11°C (昼 / 夜) 和 80% 相对湿度条件下安顿 5-7 天。

[0373] 在污染后 5/7 天,与对照植物相比较进行分级。

[0374] 在这些条件下,使用 500ppm 剂量的以下化合物观察到良好的(至少 70%) 保护: 36, 64, 65, 67, 80 和 89。

[0375] 实施例 G:对寄生霜霉(Peronospora parasitica) (十字花科蔬菜霜霉病)的体内测试

[0376] 测试用的活性组分通过以下步骤制备:在丙酮 / 吐温 / MDSO 混合物中均化,然后用水稀释,获得所需的活性材料。

[0377] 将卷心菜植物(Eminence 种)放置在起始杯中,种植到 50/50 泥炭土 - 火山灰培养基中,并在 18-20°C 生长,在子叶阶段时通过喷洒上述水性悬浮液处理该植物。用不含活性材料的水溶液处理植物,作为对照。在 24 小时之后,通过向植物喷洒寄生霜霉孢子的水性悬浮液(50000 个孢子 / 毫升)将植物污染。这些孢子收集自受感染的植物。受污染的卷心菜植物在约 5-20°C 和潮湿氛围下培养 5 天。在污染后 5 天,与对照植物相比较进行分级。

[0378] 在这些条件下,使用 500ppm 剂量的以下化合物观察到良好的(至少 70% 的病害控制)至完全的保护(100% 的病害控制):依据本发明的 2, 6, 8, 19, 27, 48, 49, 57, 73, 75, 83, 84, 87, 88, 94, 99, 108, 109, 129, 134, 135, 136, 149, 155, 164, 169, 174, 176, 179, 183, 198, 219 和 240, 而专利申请 WO-2006/120224 所揭示的实施例 5、45 和 50 的化合物在 500ppm 的剂量只观察到微弱的保护(低于 30% 的病害控制)直至毫无保护可言。

[0379] 专利申请 WO-2006/120224 所揭示的实施例 5、45 和 50 分别对应于以下化合物:

[0380] N- 环丙基 -N-[(3- 氯 -5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基) - 亚甲基] -2, 5- 二甲基 - 咪唑 -3- 羧酰胺;

[0381] N- 环丙基 -N-[(3- 氯 -5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基) - 亚甲基] -5- 氟 -1, 3- 二甲基 -1H- 吡唑 -4- 羧酰胺;

[0382] N- 环丙基 -N-[(3- 氯 -5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基) - 亚甲基] -5- 氟 -3-(三氟甲基) -1- 甲基 -1H- 吡唑 -4- 羧酰胺;

[0383] 这些结果表明,依据本发明的各个化合物的生物活性比 WO-2006/120224 所揭示的结构上最接近的化合物好得多。