

[19]中华人民共和国专利局

[51]Int.Cl⁶

A01N 43/54



[12] 发明专利申请公开说明书 // (A01N43/54,61:00,43:56,43:54,37:50)

[21] 申请号 96197804.X

[43]公开日 1998年12月2日

[11] 公开号 CN 1200651A

[22]申请日 96.9.12

[30]优先权

[32]95.9.25 [33]DE[31]19535516.4

[86]国际申请 PCT/EP96/04013 96.9.12

[87]国际公布 WO97/11606 德 97.4.3

[85]进入国家阶段日期 98.4.23

[71]申请人 巴斯福股份公司

地址 联邦德国路德维希港

[72]发明人 H·巴耶 H·萨特尔 E·阿莫曼

G·罗恩兹 S·斯特拉斯曼

H·科霍尔 G·里特茨拉夫

[74]专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商标
事务所

代理人 黄泽雄

权利要求书 5 页 说明书 31 页 附图页数 0 页

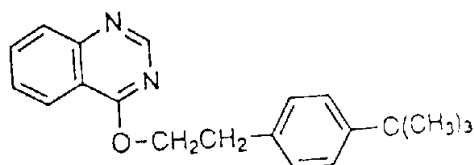
[54]发明名称 用抑制细胞色素复合物Ⅲ呼吸作用的活性物质与喹啉醚结合消灭寄生真菌的方法

[57]摘要

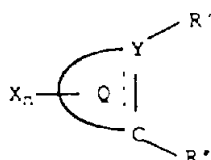
本发明涉及控制有害真菌的组合物,它含有作为活性成分的至少一种抑制细胞色素复合物Ⅲ呼吸作用的化合物和喹啉醚。本发明组合物尤其可用来控制葡萄孢属。

权利要求书

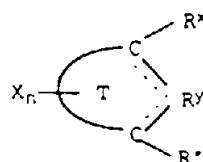
1. 一种控制有害真菌的组合物,该组合物包括在固体或液体载体中的至少一种抑制细胞色素复合物 III 的呼吸作用的活性成分 I, 和下式的喹啉醚:



2. 权利要求 1 中要求的组合物,它含有作为活性成分 I 的式 IA 或 IB 化合物,



IA



IB

其中

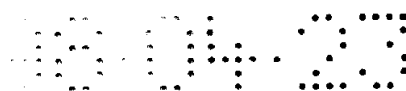
....是双键或单键;

R' 是 $-C[CO_2CH_3]=CHOCH_3$, $-C[CO_2CH_3]=NOCH_3$, $-C[CONHCH_3]=NOCH_3$, $-C[CO_2CH_3]=CHCH_3$, $-C[CO_2CH_3]=CHCH_2CH_3$, $-C[COCH_3]=NOCH_3$, $-C[COCH_2CH_3]=NOCH_3$, $-N(OCH_3)-CO_2CH_3$, $-N(CH_3)-CO_2CH_3$ 或 $-N(CH_2CH_3)-CO_2CH_3$;

R'' 是直接或通过氧基, 巯基, 氨基或烷基氨基连接的有机基团,

和基团 X 一起与它们连接的环 Q 或 T 构成一个非取代或取代双环的, 部分或完全不饱和系统, 它除了含有环碳原子外, 还可以有 1, 2 或 3 个彼此独立的选自氧, 硫和氮的杂原子;

R^x 是 $-OC[CO_2CH_3]=CHOCH_3$, $-OC[CO_2CH_3]=CHCH_3$, $-OC[CO_2CH_3]=CHCH_2CH_3$, $-SC[CO_2CH_3]=CHOCH_3$, $-SC[CO_2CH_3]=CHCH_3$, $-SC[CO_2CH_3]=CHCH_2CH_3$, $-N(CH_3)C[CO_2CH_3]=CHOCH_3$, $-N(CH_3)C[CO_2CH_3]=NOCH_3$, $-CH_2C[CO_2CH_3]=CHOCH_3$, $-CH_2C[CO_2CH_3]=NOCH_3$ 或



R^y 是氧, 硫, $=\text{CH}-$ 或 $=\text{N}-$;

n 是 0, 1, 2 或 3, 如果 $n>1$, 基团 X 可以相同或不同;

X 是氰基, 硝基, 卤素, 烷基, 卤烷基, 烷氧基, 卤代烷氧基, 烷硫基, 或

如果 $n>1$, 则为连到苯环的两个相邻的 C 原子上的 $C_3 - C_5$ 亚烷基, $C_3 - C_5$ 亚烯基, 氧基 - $C_2 - C_4$ 亚烷基, 氧基 - $C_1 - C_3$ 亚烷基氧基, 氧基 - $C_2 - C_4$ 亚烯基, 氧基 - $C_2 - C_4$ 亚烯基氧基或丁二烯二基, 这些链可以依次连接有 1 - 3 个基团, 所说基团彼此独立的选自卤素, 烷基, 卤代烷基, 烷氧基, 卤代烷氧基和烷硫基;

Y 是 $=C-$ 或 $-N-$;

Q 是苯基, 吡咯基, 噻吩基, 呋喃基, 吡唑基, 咪唑基, 噁唑基, 异噁唑基, 噻唑基, 噻二唑基, 三唑基, 吡啶基, 2 - 吡啶基, 嘧啶基或三嗪基; 及

T 是苯基, 噁唑基, 噻唑基, 噻二唑基, 噁二唑基, 吡啶基, 嘧啶基或三嗪基。

3. 权利要求 2 中要求的组合物, 它含有作为活性成分 I 的式 IA 或 IB 化合物, 其中 R'' 是芳氧基, 杂芳氧基, 芳氧基亚甲基, 杂芳氧基亚甲基, 芳基亚乙烯基或杂芳基亚乙烯基, 它们可以有 1, 2 或 3 个彼此独立的下列取代基: 烷基, 卤素, CF_3 , CHF_2 , CN , 烷氧基和苯基, 苯基本身也可以有 1, 2 或 3 个彼此独立的下列取代基: 卤素, CF_3 , CHF_2 , 苯基, CN , 苯氧基, 烷基, 烷氧基和卤代烷氧基; 或

R'' 是 $\text{CH}_2\text{ON} = \text{CR}^\alpha\text{R}^\beta$ 或 $\text{CH}_2\text{ON} = \text{CR}^\gamma\text{CR}^\delta = \text{NOR}^\epsilon$, 其中

R^α 是烷基;

R^β 是有 1, 2 或 3 个彼此独立的下列取代基的苯基, 吡啶基或嘧啶基: 烷基, 烷氧基, 卤素, 卤代烷氧基, CF_3 和 CHF_2 ;

R^γ 是烷基, 烷氧基, 卤素, 卤代烷氧基或氢;

R^δ 是氢, 氰基, 卤素, 烷基, 烷氧基, 烷硫基, 烷基氨基, 二烷基氨基, 链烯基, 链烯氧基, 链烯硫基, 链烯基氨基, N - 链烯基 - N - 烷基氨基, 炔基, 炔氧基, 炔硫基, 炔基氨基, N - 炔基 - N - 烷基氨基, 这



些基团的烃可以部分或全部被卤化，和/或有 1，2 或 3 个彼此独立的下列基团与它们相连：氰基，硝基，羟基，烷氧基，卤代烷氧基，烷氧羰基，烷硫基，烷基氨基，二烷基氨基，链烯氧基，环烷基，环烷氧基，杂环基，杂环氧基，芳基，芳氧基，芳基烷氧基，杂芳基，杂芳氧基和杂芳基烷氧基，其中环基也可以部分或全部被卤化，和/或有 1，2 或 3 个彼此独立的下列基团与它们相连：氰基，硝基，羟基，烷基，卤代烷基，环烷基，烷氧基，卤代烷氧基，烷氧羰基，烷硫基，烷基氨基，二烷基氨基，链烯基和链烯氧基；或

是环烷基，环烷氧基，环烷硫基，环烷基氨基，N - 环烷基 - N - 烷基氨基，杂环基，杂环氧基，杂环硫基，杂环基氨基，N - 杂环基 - N - 烷基氨基，芳基，芳氧基，芳硫基，芳基氨基，N - 芳基 - N - 烷基氨基，杂芳基，杂芳氧基，杂芳硫基，杂芳基氨基或 N - 杂芳基 - N - 烷基氨基，其中环基也可以部分或全部被卤化，和/或有 1，2 或 3 个彼此独立的下列基团与它们相连：氰基，硝基，羟基，烷基，卤代烷基，环烷基，烷氧基，卤代烷氧基，烷氧羰基，烷硫基，烷基氨基，二烷基氨基，链烯基，链烯氧基，苄基，苄氧基，芳基，芳氧基，杂芳基和杂芳氧基，其中芳香基团也可以部分或全部被卤化，和/或有 1，2 或 3 个下列基团与它们相连：氰基，烷基，卤代烷基，烷氧基，硝基；

R^e 是烷基，链烯基或炔基，这些基团可以部分或全部被卤化，和/或有 1，2 或 3 个下列基团与它们相连：氰基，烷氧基，环烷基。

4. 权利要求 2 中要求的组合物，它含有作为活性成分 I 的式 IA 或 IB 化合物，其中 R'' 是芳氧基，杂芳氧基，芳氧基亚甲基，杂芳氧基亚甲基，芳基亚乙烯基或杂芳基亚乙烯基，它们可以有 1，2 或 3 个彼此独立的下列取代基：烷基，卤素， CF_3 ， CHF_2 ，烷氧基和苯基，苯基本身也可以有 1，2 或 3 个彼此独立的下列取代基：卤素， CF_3 ， CHF_2 ，苯基，CN 和苯氧基；或

R'' 是 $CH_2ON = CR^{\alpha}R^{\beta}$ 或 $CH_2ON = CR^{\gamma}CR^{\delta} = NOR^e$ ，其中

R^{α} 是烷基；

R^{β} 是有 1，2 或 3 个彼此独立的下列取代基的苯基或嘧啶基：烷基，烷氧基，卤素， CF_3 和 CHF_2 ；

R^{γ} 是烷基;

R^{δ} 是烷基或苯基, 如果合适, 它们可以有 1, 2 或 3 个彼此独立的选自卤素, CF_3 和 CHF_2 的取代基;

R^{ϵ} 是烷基。

5. 权利要求 3 中要求的组合物, 它含有作为活性成分 I 的式 IA 化合物, 其中 R'' 有下列含义之一:

a) 苯氧基亚甲基, 吡啶氧基亚甲基, 嘧啶氧基亚甲基或吡唑氧基亚甲基, 其中芳香基可以有 1, 2 或 3 个彼此独立的下列取代基: 烷基, 卤素, CF_3 , CHF_2 , $-C(CH_3)=NOCH_3$ 和未被取代或被 1, 2 或 3 个卤原子和/或烷基取代的苯基;

b) 未被取代或被 1, 2 或 3 个卤原子取代, 或一个可以有卤素或氰基取代基的苯氧基取代的苯氧基或嘧啶氧基;

c) 苯氧基亚乙烯基或吡唑基亚乙烯基, 其中苯基或吡唑基可以有 1, 2 或 3 个彼此独立的下列取代基: 卤素, CF_3 , CHF_2 和苯基;

d) $CH_2ON = CR^{\alpha}R^{\beta}$, 其中

R^{α} 是烷基; 及

R^{β} 是可以有 1, 2 或 3 个彼此独立的下列取代基的苯基: 烷基, 卤素, CF_3 和 CHF_2 , 或未被取代或被 1 或 2 个烷氧基取代的嘧啶基;

e) $CH_2ON = CR^{\gamma}CR^{\delta} = NOR^{\epsilon}$, 其中

R^{γ} 是烷基, 烷氧基或卤素;

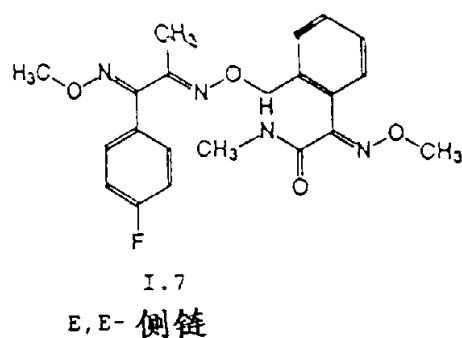
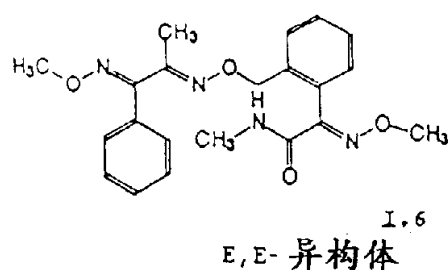
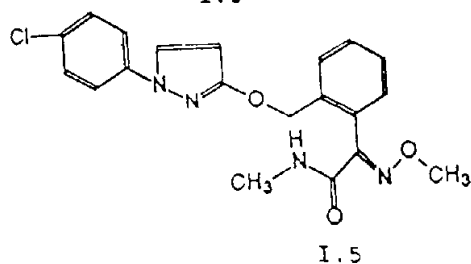
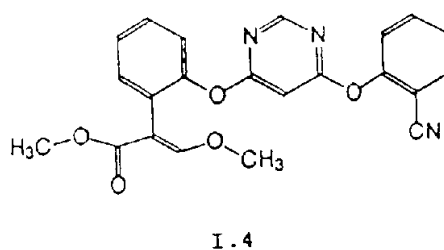
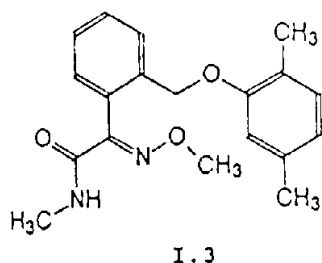
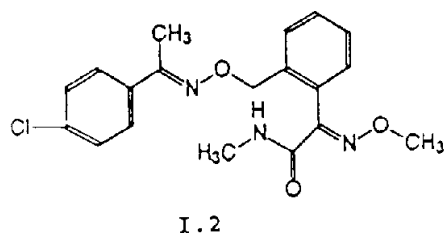
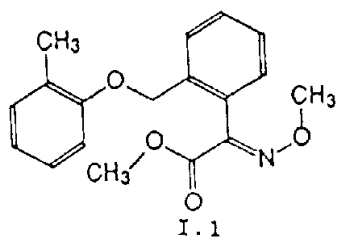
R^{δ} 是烷基, 氰基, 卤素, 烷氧基, 链烯基或未被取代或被 1, 2 或 3 个卤原子取代的苯基; 及

R^{ϵ} 是烷基。

6. 权利要求 2 - 5 之一要求的组合物, 其中 R' 是 $-C[CO_2CH_3]=NOCH_3$, $-C[CONHCH_3]=NOCH_3$ 或 $-C[CO_2CH_3]=CHOCH_3$ 。

7. 权利要求 2 - 6 之一要求的组合物, 含有作为活性成分 I 的式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基及 n 是 0。

8. 权利要求 1 要求的组合物, 含有作为活性成分 I 的下式化合物,



9. 以上任一权利要求所要求的组合物，它可分为两部分，一部分含有在固体或液体载体中的活性成分 I，另一部分含有在固体或液体载体中的喹啉。

10. 一种控制有害真菌的方法，包括用权利要求 1 - 9 之一的组合物处理真菌及其周围环境，或处理要防止真菌感染的材料，植物，种子，土壤，区域或空间，可以同时即联合或分别地，或者接连地使用活性成分 I。

说明书

用抑制细胞色素复合物 III 呼吸作用的活性 物质与喹螨醚结合消灭寄生真菌的方法

本发明涉及控制有害真菌的组合物和用这种组合物控制有害真菌的方法。

已有文献公开了抑制细胞色素 bc1 复合物 (细胞色素复合物 III) 的活性成分可用作杀真菌剂。

[U. Brandt, U. Haase, H. Schagger, G. von Jagow: "Spezifität und Wirkmechanismus der Strobilurine" (Specificity and Mechanism of Action of the Strobilurins), Dechema Monograph Vol. 129, 27-38, VCH Verlagsgesellschaft Weinheim, 1993; J.M. Clough: Natural Product Reports, 1993, 565-574; F. Röhl, H. Sauter: Biochem. Soc. Trans. 22, 635 (1993)].

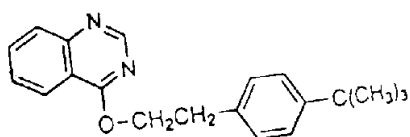
但是, 事实证明, 如果用这些活性成分作杀真菌剂, 它们的活性只是短暂的, 即短时间后就可以观察到真菌重新生长。

因此, 本发明的一个目的是提供控制有害真菌, 特别是葡萄孢属的改进方法。

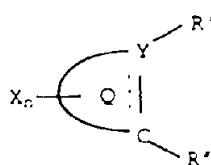
令人惊喜的是我们已经发现, 用含有抑制细胞色素复合物 III 呼吸作用的活性成分并结合喹螨醚的组合物可以实现这个目的, 喹螨醚的杀螨活性是已知的 (参见《杀虫剂手册》(Pesticide Manual), 第 10 版, 1994; CAS 登记号 120928 - 09 - 8)。

因此, 本发明涉及控制有害真菌的组合物, 它含有在固体或液体载体中的:

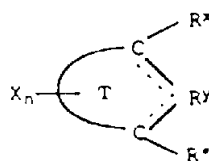
- 至少一种活性成分 I, 它抑制细胞色素复合物 III 的呼吸作用, 和
- 下式的喹螨醚,



活性成分 I 是优选式 IA 或 IB 化合物,



IA



IB

其中

....是双键或单键;

R' 是 $-C[CO_2CH_3]=CHOCH_3$, $-C[CO_2CH_3]=NOCH_3$, $-C[CONHCH_3]=NOCH_3$, $-C[CO_2CH_3]=CHCH_3$, $-C[CO_2CH_3]=CHCH_2CH_3$, $-C[COCH_3]=NOCH_3$, $-C[COCH_2CH_3]=NOCH_3$, $-N(OCH_3)-CO_2CH_3$, $-N(CH_3)-CO_2CH_3$ 或 $-N(CH_2CH_3)-CO_2CH_3$;

R'' 是直接或通过氧基, 巯基, 氨基或烷基氨基连接的有机基团, 或者和基团 X 一起与它们连接的环 Q 或 T 构成一个非取代或取代的双环的, 部分或完全不饱和系统, 它除了含有环碳原子外, 还可以有 1, 2 或 3 个彼此独立的选自氧, 硫和氮的杂原子;

R^x 是 $-OC[CO_2CH_3]=CHOCH_3$, $-OC[CO_2CH_3]=CHCH_3$, $-OC[CO_2CH_3]=CHCH_2CH_3$, $-SC[CO_2CH_3]=CHOCH_3$, $-SC[CO_2CH_3]=CHCH_3$, $-SC[CO_2CH_3]=CHCH_2CH_3$, $N(CH_3)C[CO_2CH_3]=CHOCH_3$, $-N(CH_3)C[CO_2CH_3]=NOCH_3$, $CH_2C[CO_2CH_3]=CHOCH_3$, $-CH_2C[CO_2CH_3]=NOCH_3$ 或 $CH_2C[CONHCH_3]=NOCH_3$;

R^y 是氧, 硫, $=CH-$ 或 $=N-$;

n 是 0, 1, 2 或 3, 如果 $n > 1$, 基团 X 可以相同或不同;

X 是氰基, 硝基, 卤素, 烷基, 卤代烷基, 烷氧基, 卤代烷氧基, 烷硫基, 或

如果 $n > 1$, 则为连到苯环的两个相邻的 C 原子上的 $C_3 - C_5$ 亚烷基, $C_3 - C_5$ 亚烯基, 氧基 - $C_2 - C_4$ 亚烷基, 氧基 - $C_1 - C_3$ 亚烷基氧基, 氧基 - $C_2 - C_4$ 亚烯基, 氧基 - $C_2 - C_4$ 亚烯基氧基或丁二烯二基, 这些链依次可以连接有 1 - 3 个基团, 所说基团彼此独立的选自卤素, 烷基, 卤代烷

基, 烷氧基, 卤代烷氧基和烷硫基;

Y 是=C-或-N-;

Q 是苯基, 吡咯基, 噻吩基, 呋喃基, 吡唑基, 咪唑基, 噁唑基, 异噁唑基, 噻唑基, 噻二唑基, 三唑基, 吡啶基, 2-吡啶基, 嘧啶基或三嗪基; 及

T 是苯基, 噁唑基, 噻唑基, 噻二唑基, 噁二唑基, 吡啶基, 嘧啶基或三嗪基。

取代基 R”尤其是烷基, 烯基, 炔基, 芳基, 杂芳基, 芳烷基, 杂芳烷基, 芳烯基, 杂芳烯基, 芳炔基或杂芳炔基, 它们可以被一个或多个下列基团取代: O, S, SO, SO₂, NR (R = H 或烷基), CO, COO, OCO, CONH, NHCO 和 NHCONH, 或定义如下的下式基团: CH₂ON = CR^αCR^β 或 CH₂ON = CR^γCR^δ = NOR^ε。这些基团也可以有一个或多个 (优选 1, 2 或 3 个) 彼此独立的下列取代基: 烷基, 烷氧基, 卤素, 卤代烷基 (尤其是 CF₃ 和 CHF₂) 和芳基。上述取代基也可以有 1, 2 或 3 个彼此独立的下列取代基: 卤素, 卤代烷基 (尤其是 CF₃ 和 CHF₂), 苯基, CN 和苯氧基。

在下面表 I.1 - I.8 所列文献中对这些化合物及其制备有所描述。没有列于这些表中的化合物也可以用类似的方法制备。

本发明范围内的卤素是氟, 氯, 溴和碘, 特别是氟, 氯和溴。

术语“烷基”包括直链和支链烷基, 优选直链或支链 C₁ - C₁₂ 烷基, 特别是 C₁ - C₆ 烷基。这些烷基的实例尤其是甲基, 乙基, 丙基, 1-甲基乙基, 丁基, 1-甲基丙基, 2-甲基丙基, 1,1-二甲基乙基, 正戊基, 1-甲基丁基, 2-甲基丁基, 3-甲基丁基, 1,2-二甲基丙基, 1,1-二甲基丙基, 2,2-二甲基丙基, 1-乙基丙基, 正己基, 1-甲基戊基, 2-甲基戊基, 3-甲基戊基, 4-甲基戊基, 1,2-二甲基丁基, 1,3-二甲基丁基, 2,3-二甲基丁基, 1,1-二甲基丁基, 2,2-二甲基丁基, 3,3-二甲基丁基, 1,1,2-三甲基丙基, 1,2,2-三甲基丙基, 1-乙基丁基, 2-乙基丁基, 1-乙基-2-甲基丙基, 正庚基, 1-甲基己基, 1-乙基戊基, 2-乙基戊基, 1-丙基丁基, 辛基, 癸基, 十二烷基。

卤代烷基是部分或全部被一个或多个卤原子, 尤其是氟和氯原子卤化

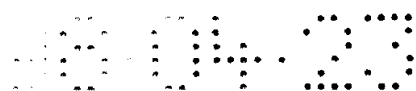
的如上定义的烷基。优选存在 1 - 3 个卤原子，特别优选二氟甲基或三氟甲基。

上面烷基和卤代烷基的定义同样适用于烷氧基，卤代烷氧基，烷硫基和卤代烷硫基或其它类似基团中的烷基和卤代烷基。

链烯基包括直链和支链烯基，优选直链或支链 $C_3 - C_{12}$ 链烯基，特别是 $C_3 - C_6$ 链烯基。链烯基的实例是 2 - 丙烯基，2 - 丁烯基，3 - 丁烯基，1 - 甲基 - 2 - 丙烯基，2 - 甲基 - 2 - 丙烯基，2 - 戊烯基，3 - 戊烯基，4 - 戊烯基，1 - 甲基 - 2 - 丁烯基，2 - 甲基 - 2 - 丁烯基，3 - 甲基 - 2 - 丁烯基，1 - 甲基 - 3 - 丁烯基，2 - 甲基 - 3 - 丁烯基，3 - 甲基 - 3 - 丁烯基，1,1 - 二甲基 - 2 - 丙烯基，1,2 - 二甲基 - 2 - 丙烯基，1 - 乙基 - 2 - 丙烯基，2 - 己烯基，3 - 己烯基，4 - 己烯基，5 - 己烯基，1 - 甲基 - 2 - 戊烯基，2 - 甲基 - 2 - 戊烯基，3 - 甲基 - 2 - 戊烯基，4 - 甲基 - 2 - 戊烯基，1 - 甲基 - 3 - 戊烯基，2 - 甲基 - 3 - 戊烯基，3 - 甲基 - 3 - 戊烯基，4 - 甲基 - 3 - 戊烯基，1 - 甲基 - 4 - 戊烯基，2 - 甲基 - 4 - 戊烯基，3 - 甲基 - 4 - 戊烯基，4 - 甲基 - 4 - 戊烯基，1,1 - 二甲基 - 2 - 丁烯基，1,1 - 二甲基 - 3 - 丁烯基，1,1 - 二甲基 - 3 - 丁烯基，1,2 - 二甲基 - 2 - 丁烯基，1,2 - 二甲基 - 3 - 丁烯基，1,3 - 二甲基 - 2 - 丁烯基，1,3 - 二甲基 - 3 - 丁烯基，2,2 - 二甲基 - 3 - 丁烯基，2,3 - 二甲基 - 2 - 丁烯基，2,3 - 二甲基 - 3 - 丁烯基，1 - 乙基 - 2 - 丁烯基，1 - 乙基 - 3 - 丁烯基，2 - 乙基 - 2 - 丁烯基，2 - 乙基 - 3 - 丁烯基，1,1,2 - 三甲基 - 2 - 丙烯基，1 - 乙基 - 1 - 甲基 - 2 - 丙烯基和 1 - 乙基 - 2 - 甲基 - 2 - 丙烯基，特别是 2 - 丙烯基，2 - 丁烯基，3 - 甲基 - 2 - 丁烯基和 3 - 甲基 - 2 - 戊烯基。

链烯基可以部分或全部被一个或多个卤原子，尤其是氟和氯原子卤化。优选有 1 - 3 个卤原子。

炔基包括直链和支链炔基，优选直链或支链 $C_3 - C_{12}$ 炔基，特别是 $C_3 - C_6$ 炔基。炔基的实例是 2 - 丙炔基，2 - 丁炔基，3 - 丁炔基，1 - 甲基 - 2 - 丙炔基，2 - 戊炔基，3 - 戊炔基，4 - 戊炔基，1 - 甲基 - 3 - 丁炔基，2 - 甲基 - 3 - 丁炔基，1 - 甲基 - 2 - 丁炔基，1,1 - 二甲基 - 2 - 丙炔基，1 - 乙基 - 2 - 丙炔基，2 - 己炔基，3 - 己炔基，4 -



己炔基, 5-己炔基, 1-甲基-2-戊炔基, 1-甲基-3-戊炔基, 1-甲基-4-戊炔基, 2-甲基-3-戊炔基, 2-甲基-4-戊炔基, 3-甲基-4-戊炔基, 4-甲基-2-戊炔基, 1,2-二甲基-2-丁炔基, 1,1-二甲基-3-丁炔基, 1,2-二甲基-3-丁炔基, 2,2-二甲基-3-丁炔基, 1-乙基-2-丁炔基, 1-乙基-3-丁炔基, 2-乙基-3-丁炔基和1-乙基-1-甲基-2-丙炔基。

上面关于烯基及其卤代取代基和关于炔基的定义同样适用于烯氧基和炔氧基。

环烷基优选 $C_3 - C_6$ 环烷基, 如环丙基, 环丁基, 环戊基或环己基。如果环烷基被取代, 优选 1-3 个 $C_1 - C_4$ 烷基作为取代基。

环烯基优选 $C_4 - C_6$ 环烯基, 如环丁烯基, 环戊烯基或环己烯基。如果环烯基被取代, 优选 1-3 个 $C_1 - C_4$ 烷基作为取代基。

环烷氧基优选 $C_5 - C_6$ 环烷氧基, 如环戊烷氧基或环己烷氧基。如果环烷氧基被取代, 优选 1-3 个 $C_1 - C_4$ 烷基作为取代基。

环烯氧基优选 $C_5 - C_6$ 环烯氧基, 如环戊氧基或环己氧基。如果环烯氧基被取代, 优选 1-3 个 $C_1 - C_4$ 烷基作为取代基。

优选的芳基是苯基。

杂芳基优选是有 1, 2 或 3 个彼此独立的杂原子 N, O 和 S 的 5-或 6-元芳香杂环。特别优选吡啶基, 嘧啶基, 噻唑基或吡唑基。

杂环基优选是有 1, 2 或 3 个彼此独立的杂原子 N, O 和 S 的 5-或 6-元饱和或不饱和杂环。优选是所述“杂芳基”的二氢, 四氢和六氢衍生物之一。特别优选吡咯烷基, 四氢呋喃基, 咪唑烷基, 吡唑烷基, 噁唑烷基, 异噁唑烷基, 噻唑烷基, 异噻唑烷基, 哌啶基或吗啉基。

在优选实例中本发明组合物含有式 IA 或 IB 化合物, 其中 R'' 是芳氧基, 杂芳氧基, 芳氧基亚甲基, 杂芳氧基亚甲基, 芳基亚乙烯基或杂芳基亚乙烯基, 它们可以有 1, 2 或 3 个彼此独立的下列取代基: 烷基, 卤素, CF_3 , CHF_2 , CN , 烷氧基和苯基, 苯基本身也可以有 1, 2 或 3 个彼此独立的下列取代基: 卤素, CF_3 , CHF_2 , 苯基, CN , 苯氧基, 烷基, 烷氧基和卤代烷氧基; 或

R'' 是 $CH_2ON = CR^\alpha R^\beta$ 或 $CH_2ON = CR^\gamma CR^\delta = NOR^e$, 其中

R^{α} 是烷基;

R^{β} 是有 1, 2 或 3 个彼此独立的下列取代基的苯基, 吡啶基或嘧啶基: 烷基, 烷氧基, 卤素, 卤代烷氧基, CF_3 和 CHF_2 ;

R^{γ} 是烷基, 烷氧基, 卤素, 卤代烷氧基或氢;

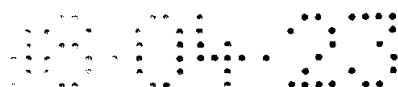
R^{δ} 是氢, 氰基, 卤素, 烷基, 烷氧基, 烷硫基, 烷基氨基, 二烷基氨基, 链烯基, 链烯氧基, 链烯硫基, 链烯基氨基, N - 链烯基 - N - 烷基氨基, 炔基, 炔氧基, 炔硫基, 炔基氨基, N - 炔基 - N - 烷基氨基, 这些基团的烃可以部分或全部被卤化, 和/或有 1, 2 或 3 个彼此独立的下列基团与它们相连: 氰基, 硝基, 羟基, 烷氧基, 卤代烷氧基, 烷氧羰基, 烷硫基, 烷基氨基, 二烷基氨基, 链烯氧基, 环烷基, 环烷氧基, 杂环基, 杂环氧基, 芳基, 芳氧基, 芳基烷氧基, 杂芳基, 杂芳氧基和杂芳基烷氧基, 其中环基也可以部分或全部被卤化, 和/或有 1, 2 或 3 个彼此独立的下列基团与它们相连: 氰基, 硝基, 羟基, 烷基, 卤代烷基, 环烷基, 烷氧基, 卤代烷氧基, 烷氧羰基, 烷硫基, 烷基氨基, 二烷基氨基, 链烯基和链烯氧基; 或

R^{δ} 是环烷基, 环烷氧基, 环烷硫基, 环烷基氨基, N - 环烷基 - N - 烷基氨基, 杂环基, 杂环氧基, 杂环硫基, 杂环基氨基, N - 杂环基 - N - 烷基氨基, 芳基, 芳氧基, 芳硫基, 芳基氨基, N - 芳基 - N - 烷基氨基, 杂芳基, 杂芳氧基, 杂芳硫基, 杂芳基氨基或 N - 杂芳基 - N - 烷基氨基, 其中环基也可以部分或全部被卤化, 和/或有 1, 2 或 3 个彼此独立的下列基团与它们相连: 氰基, 硝基, 羟基, 烷基, 卤代烷基, 环烷基, 烷氧基, 卤代烷氧基, 烷氧羰基, 烷硫基, 烷基氨基, 二烷基氨基, 链烯基, 链烯氧基, 苄基, 苄氧基, 芳基, 芳氧基, 杂芳基和杂芳氧基, 其中芳香基团也可以部分或全部被卤化, 和/或有 1, 2 或 3 个下列基团与它们相连: 氰基, 烷基, 卤代烷基, 烷氧基, 硝基;

R^{ϵ} 是烷基, 链烯基或炔基, 这些基团可以部分或全部被卤化, 和/或有 1, 2 或 3 个下列基团与它们相连: 氰基, 烷氧基, 环烷基。

特别优选的式 IA 或 IB 化合物是其中 R'' 有下列含义之一的化合物:

a) 苯氧基亚甲基, 吡啶氧基亚甲基, 嘧啶氧基亚甲基或吡唑氧基亚甲基, 其中芳香基团可以有 1, 2 或 3 个彼此独立的下列取代基: 烷基, 卤素,



CF_3 , CHF_2 , $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NOCH}_3$ 和未被取代或被 1, 2 或 3 个卤原子和/或烷基取代的苯基;

b) 未被取代或被 1, 2 或 3 个卤原子取代, 或一个可以有卤素或氰基取代基的苯氧基取代的苯氧基或嘧啶氧基;

c) 苯基亚乙烯基或吡唑基亚乙烯基, 其中苯基或吡唑基可以有 1, 2 或 3 个彼此独立的下列取代基: 卤素, CF_3 , CHF_2 和苯基;

d) $\text{CH}_2\text{ON} = \text{CR}^\alpha\text{R}^\beta$, 其中

R^α 是烷基; 及

R^β 是可以有 1, 2 或 3 个彼此独立的下列取代基的苯基: 烷基, 卤素, CF_3 和 CHF_2 , 或未被取代或被 1 或 2 个烷氧基取代的嘧啶基;

e) $\text{CH}_2\text{ON} = \text{CR}^\gamma\text{CR}^\delta = \text{NOR}^\epsilon$, 其中

R^γ 是烷基, 烷氧基或卤素;

R^δ 是烷基, 氰基, 卤素, 烷氧基, 链烯基或未被取代或被 1, 2 或 3 个卤原子取代的苯基; 及

R^ϵ 是烷基。

特别优选的化合物是其中 Q 是苯基且 n 是 0 的式 IA 化合物。

特别合适的活性成分 I 列于下列表中。

表 I.1A

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 $-\text{C}(\text{CO}_2\text{CH}_3)=\text{CHOCH}_3$, n 是 0, R'' 是未取代或取代的 (杂) 芳氧基亚甲基, 未取代或取代的 (杂) 芳基有下列含义:

序号	未取代或取代的 (杂) 芳基	参考文献
I.1A-1	2- CH_3 - C_6H_4	EP-A 226 917
I.1A-2	2,5-(CH_3) ₂ - C_6H_3	EP-A 226 917
I.1A-3	2- CH_3 , 4- $\text{C}[\text{CH}_3]=\text{NOCH}_3$ - C_6H_3	EP-A 386 561
I.1A-4	2- $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, 6- CF_3 - 嘧啶 -4-基	EP-A 407 873
I.1A-5	2,4-(CH_3) ₂ - C_6H_3	EP-A 226 917

表 I.1B

式 IA 化合物, 其中 R' 是 $-\text{C}(\text{CO}_2\text{CH}_3)=\text{CHOCH}_3$, Q 是苯基, n 是 0,



R'' 是未取代或取代的(杂)芳氧基, 未取代或取代的(杂)芳基有下列含义:

序号	未取代或取代的(杂)芳基	参考文献
I.1B-1	C_6H_5	EP-A 178 826
I.1B-2	6-[2-CN- C_6H_4 -O]- 嘧啶 -4-基	EP-A 382 375

表 I.1C

式 IA 化合物, 其中 R' 是 $-C(CO_2CH_3)=CHOCH_3$, Q 是苯基, n 是0, R'' 是未取代或取代的(杂)芳基亚乙烯基, 未取代或取代的(杂)芳基有下列含义:

序号	未取代或取代的(杂)芳基	reference
I.1C-1	1-(2,4- Cl_2 - C_6H_3), 5- CF_3 - 吡唑 -4-基	EP-A 528 245
I.1C-2	1-(4- Cl - C_6H_4)- 吡唑 -4-基	EP-A 378 755
I.1C-3	3- CF_3 - C_6H_4	EP-A 203 606
I.1C-4	3- Cl - C_6H_4	EP-A 203 606
I.1C-5	4- C_6H_5 - C_6H_4	EP-A 203 606

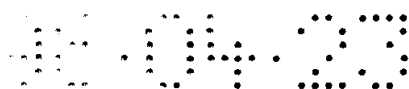
表 I.1D

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 $-C(CO_2CH_3)=CHOCH_3$, n 是0, R'' 是 $CH_2ON=CR^{\alpha}R^{\beta}$, 其中 R^{α} 和 R^{β} 有下列含义:

序号	R^{α}	R^{β}	参考文献
I.1D-1	CH_3	4- Cl - C_6H_4	EP-A 370 629
I.1D-2	CH_3	3- CF_3 - C_6H_4	EP-A 370 629
I.1D-3	CH_3	4-O CH_2CH_3 - 嘧啶 -2-基	WO-A 92/18,487

表 I.1E

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 $-C(CO_2CH_3)=CHOCH_3$, n 是0,



R'' 是 $CH_2ON=CR^YCR^\delta=NOR^E$, 其中 R^Y , R^δ 和 R^E 有下列含义:

序号	R^Y	R^δ	R^E	参考文献
I.1E-1	CH ₃	CH ₃	CH ₃	WO-A 95/21153
I.1E-2	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	WO-A 95/21153
I.1E-3	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	WO-A 95/21153
I.1E-4	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₂ CH ₃	WO-A 95/21153
I.1E-5	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	WO-A 95/21153
I.1E-6	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₃	WO-A 95/21153

表 I.2A

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 $-C(CO_2CH_3)=NOCH_3$, n 是 0, R'' 是未取代或取代的 (杂) 芳氧基亚甲基, 未取代或取代的 (杂) 芳基有下列含义:

序号	未取代或取代的 (杂) 芳基	参考文献
I.2A-1	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	EP-A 253 213
I.2A-2	2,5-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃	EP-A 400 417
I.2A-3	2,4-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃	EP-A 400 417
I.2A-4	2,3,5-(CH ₃) ₃ -C ₆ H ₂	EP-A 400 417
I.2A-5	2-Cl, 5-CH ₃ -C ₆ H ₃	EP-A 400 417
I.1A-6	2-CH ₃ , 4-C[CH ₃]=NOCH ₃ -C ₆ H ₃	EP-A 386 561

表 I.2B

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 $-C(CO_2CH_3)=NOCH_3$, n 是 0, R'' 是未取代或取代的 (杂) 芳氧基, 未取代或取代的 (杂) 芳基有下列含义:

序号	未取代或取代的 (杂) 芳基	参考文献
I.2B-1	C ₆ H ₅	EP-A 253 213
I.2B-2	6-[2-CN-C ₆ H ₄ -O]- 嘧啶 -4- 基	EP-A 468 684

表 I.2C

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 $-C(CO_2CH_3)=NOCH_3$, n 是 0,

R''是 $\text{CH}_2\text{ON}=\text{CR}^\alpha\text{R}^\beta$, 其中 R^α 和 R^β 有下列含义:

序号	R^α	R^β	参考文献
I.2C-1	CH_3	4-Cl- C_6H_4	EP-A 463 488
I.2C-2	CH_3	3-Cl- C_6H_4	EP-A 463 488
I.2C-3	CH_3	4- CF_3 - C_6H_4	EP-A 463 488
I.2C-4	CH_3	3- CF_3 - C_6H_4	EP-A 463 488
I.2C-5	CH_3	4- CH_3 - C_6H_4	EP-A 463 488
I.2C-6	CH_3	4- OCH_2CH_3 - 嘧啶 -2- 基	EP-A 472 300
I.2C-7	CH_3	3,5- Cl_2 - C_6H_3	EP-A 463 488

表 I.2D

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 $-\text{C}(\text{CO}_2\text{CH}_3)=\text{NOCH}_3$, n 是 0, R'' 是 $\text{CH}_2\text{ON}=\text{CR}^\gamma\text{CR}^\delta=\text{NOR}^\epsilon$, 其中 R^γ , R^δ 和 R^ϵ 有下列含义:

序号	R^γ	R^δ	R^ϵ	参考文献
I.2D-1	CH_3	CH_3	CH_3	WO-A 95/21153
I.2D-2	CH_3	CH_3	CH_2CH_3	WO-A 95/21153
I.2D-3	CH_3	C_6H_5	CH_3	WO-A 95/21153
I.2D-4	CH_3	C_6H_5	CH_2CH_3	WO-A 95/21153
I.2D-5	CH_3	4-Cl- C_6H_4	CH_3	WO-A 95/21153
I.2D-6	CH_3	4-Cl- C_6H_4	CH_2CH_3	WO-A 95/21153

表 I.3A

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 $-\text{C}(\text{CONHCH}_3)=\text{NOCH}_3$, n 是 0, R'' 是未取代或取代的 (杂) 芳氧基亚甲基, 未取代或取代的 (杂) 芳基有下列含义:

序号	未取代或取代的 (杂) 芳基	参考文献
I.3A-1	2- CH_3 - C_6H_4	EP-A 477 631
I.3A-2	2,5-(CH_3) ₂ - C_6H_3	EP-A 477 631

I.3A-3	2,4-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃	EP-A 477 631
I.3A-4	2,3,5-(CH ₃) ₃ -C ₆ H ₂	EP-A 477 631
I.3A-5	2-CH ₃ , 4-C[CH ₃]=NOCH ₃ -C ₆ H ₃	EP-A 579 124
I.3A-6	1-[4-Cl-C ₆ H ₄]-吡唑 -3-基	WO-A 94/19331
I.3A-7	1-[2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃]-吡唑 -3-yl	WO-A 94/19331

表 I.3B

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 -C(CONHCH₃)=NOCH₃, n 是 0, R'' 是未取代或取代的 (杂) 芳氧基, 未取代或取代的 (杂) 芳基有下列含义:

序号	未取代或取代的 (杂) 芳基	参考文献
I.3B-1	C ₆ H ₅	EP-A 398 692
I.3B-2	6-[2-CN-C ₆ H ₄ -O]- 嘧啶 4-基	GB-A 2 253 624

表 I.3C

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 -C(CONHCH₃)=NOCH₃, n 是 0, R'' 是未取代或取代的 (杂) 芳基亚乙烯基, 未取代或取代的 (杂) 芳基有下列含义:

序号	未取代或取代的 (杂) 芳基	参考文献
I.3C-1	1-[2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃], 5-CF ₃ -吡唑 -4-基	DE-A 44 23 615.8

表 I.3D

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 -C(CONHCH₃)=NOCH₃, n 是 0, R'' 是 CH₂ON=CR^αR^β, 其中 R^α 和 R^β 有下列含义:

序号	R ^α	R ^β	参考文献
I.3D-1	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	EP-A 463 488
I.3D-2	CH ₃	3-Cl ₃ -C ₆ H ₄	EP-A 463 488
I.3D-3	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	EP-A 585 751
I.3D-4	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	EP-A 585 751
I.3D-5	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	EP-A 463 488

I.3D-6	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃	EP-A 463 488
I.3D-7	CH ₃	2-OCH ₂ CH ₃ -嘧啶 -2-基	WO-A 92/13,830

表 I.3E

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 -C(CONHCH₃)=NOCH₃, n 是 0, R'' 是 CH₂ON=CR^γCR^δ=NOR^ε, 其中 R^γ, R^δ 和 R^ε 有下列含义:

序号	R ^γ	R ^δ	R ^ε	参考文献
I.3E-1	CH ₃	CH ₃	CH ₃	WO-A 95/21154
I.3E-2	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	WO-A 95/21154
I.3E-3	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	WO-A 95/21154
I.3E-4	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₂ CH ₃	WO-A 95/21154
I.3E-5	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	WO-A 95/21154
I.3E-6	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₃	WO-A 95/21154
I.3E-7	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄	CH ₃	WO-A 95/21154

表 I.4A

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 -C(CO₂CH₃)=CHCH₃, n 是 0, R'' 是未取代或取代的 (杂) 芳氧基亚甲基, 未取代或取代的 (杂) 芳基有下列含义:

序号	未取代或取代的 (杂) 芳基	参考文献
I.4A-1	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	EP-A 280 185
I.4A-2	2,5-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃	EP-A 513 580
I.4A-3	2,4-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃	EP-A 513 580
I.4A-4	2,3,5-(CH ₃) ₃ -C ₆ H ₂	EP-A 513 580

I.4A-5	2-Cl, 5-CH ₃ -C ₆ H ₃	EP-A 513 580
I.4A-6	2-CH ₃ , 4-C[CH ₃]=NOCH ₃ -C ₆ H ₃	EP-A 513 580
I.4A-7	1-[4-Cl-C ₆ H ₄]-吡唑 -3-基	DE-A 44 15 483.6

表 I.4B

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 -C(CO₂CH₃)=CHCH₃, n 是 0, R'' 是未取代或取代的 (杂) 芳氧基, 未取代或取代的 (杂) 芳基有下列含义:

序号	未取代或取代的 (杂) 芳基	参考文献
I.4B-1	C ₆ H ₅	EP-A 513 580

表 I.4C

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 -C(CO₂CH₃)=CHCH₃, n 是 0, R'' 是 CH₂ON=CR^γCR^δ=NOR^ε, 其中 R^γ, R^δ 和 R^ε 有下列含义:

序号	R ^γ	R ^δ	R ^ε	参考文献
I.4C-1	CH ₃	CH ₃	CH ₃	WO-A 95/21153
I.4C-2	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	WO-A 95/21153
I.4C-3	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	WO-A 95/21153
I.4C-4	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₂ CH ₃	WO-A 95/21153
I.4C-5	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	WO-A 95/21153
I.4C-6	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₃	WO-A 95/21153

表 I.5A

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 -C(CO₂CH₃)=CHCH₂CH₃, n 是 0, R'' 是未取代或取代的 (杂) 芳氧基亚甲基, 未取代或取代的 (杂) 芳基有下列含义:

序号	未取代或取代的(杂)芳基	参考文献
I.5A-1	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	EP-A 513 580
I.5A-2	2,5-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃	EP-A 513 580
I.5A-3	2,4-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃	EP-A 513 580
I.5A-4	2,3,5-(CH ₃) ₃ -C ₆ H ₂	EP-A 513 580
I.5A-5	2-Cl, 5-CH ₃ -C ₆ H ₃	EP-A 513 580
I.5A-6	2-CH ₃ , 4-C[CH ₃]=NOCH ₃ -C ₆ H ₃	EP-A 513 580

表 I.5B

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 -C(CO₂CH₃)=CHCH₂CH₃, n 是 0, R'' 是未取代或取代的(杂)芳氧基, 未取代或取代的(杂)芳基有下列含义:

序号	未取代或取代的(杂)芳基	参考文献
I.5B-1	C ₆ H ₅	EP-A 513 580

表 I.5C

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 -C(CO₂CH₃)=CHCH₂CH₃, n 是 0, R'' 是 CH₂ON=CR^γCR^δ=NOR^ε, 其中 R^γ, R^δ 和 R^ε 有下列含义:

序号	R ^γ	R ^δ	R ^ε	参考文献
I.5C-1	CH ₃	CH ₃	CH ₃	WO-A 957 21153
I.5C-2	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	WO-A 95/21153
I.5C-3	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	WO-A 95/21153
I.5C-4	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₂ CH ₃	WO-A 95/21153
I.5C-5	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	WO-A 95/21153
I.5C-6	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₃	WO-A 95/21153

表 I.6A

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 -C(COCH₃)=NOCH₃, n 是 0, R'' 是未取代或取代的(杂)芳氧基亚甲基, 未取代或取代的(杂)芳基有下列含义:

序号	未取代或取代的 (杂) 芳基	参考文献
I.6A-1	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	EP-A 498 188
I.6A-2	2,5-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃	EP-A 498 188
I.6A-3	2,4-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃	EP-A 498 188
I.6A-4	2,3,5-(CH ₃) ₃ -C ₆ H ₂	EP-A 498 188
I.6A-5	2-CH ₃ , 4-C[CH ₃]=NOCH ₃ -C ₆ H ₃	EP-A 498 188

表 I.6B

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 -C(COCH₃)=NOCH₃, n 是 0, R'' 是未取代或取代的 (杂) 芳氧基, 未取代或取代的 (杂) 芳基有下列含义:

序号	未取代或取代的 (杂) 芳基	参考文献
I.6B-1	C ₆ H ₅	EP-A 498 188
I.6B-2	6-[2-CN-C ₆ H ₄ -O]- 嘧啶 -4-基	EP-A 498 188

表 I.7A

式 IA 化合物, 其中 Q 是苯基, R' 是 -C(COCH₂CH₃)=NOCH₃, n 是 0, R'' 是未取代或取代的 (杂) 芳氧基亚甲基, 未取代或取代的 (杂) 芳基有下列含义:

序号	未取代或取代的 (杂) 芳基	参考文献
I.7A-1	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	EP-A 498 188
I.7A-2	2,5-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃	EP-A 498 188
I.7A-3	2,4-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃	EP-A 498 188
I.7A-4	2,3,5-(CH ₃) ₃ -C ₆ H ₂	EP-A 498 188
I.7A-5	2-CH ₃ , 4-C[CH ₃]=NOCH ₃ -C ₆ H ₃	EP-A 498 188

表 I.7B



式 IA 化合物，其中 Q 是苯基，R' 是 $-\text{C}(\text{COCH}_2\text{CH}_3)=\text{NOCH}_3$ ，n 是 0，R'' 是未取代或取代的（杂）芳氧基，未取代或取代的（杂）芳基有下列含义：

序号	未取代或取代的（杂）芳基	参考文献
I.7B-1	C_6H_5	EP-A 498 188
I.7B-2	6-[2-CN- C_6H_4 -O]- 嘧啶 -4- 基	EP-A 498 188

表 I.8A

式 IA 化合物，其中 Q 是苯基，R' 是 $-\text{N}(\text{OCH}_3)-\text{CO}_2\text{CH}_3$ ，n 是 0，R'' 是未取代或取代的（杂）芳氧基亚甲基，未取代或取代的（杂）芳基有下列含义：

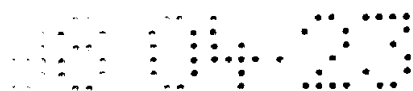
序号	未取代或取代的（杂）芳基	参考文献
I.8A-1	2- CH_3 - C_6H_4	WO-A 93/15,046
I.8A-2	2,5-(CH_3) ₂ - C_6H_3	WO-A 93/15,046
I.8A-3	2,4-(CH_3) ₂ - C_6H_3	WO-A 93/15,046
I.8A-4	2,3,5-(CH_3) ₃ - C_6H_2	WO-A 93/15,046
I.8A-5	2-Cl, 5- CH_3 - C_6H_3	WO-A 93/15,046
I.8A-6	2- CH_3 , 4- $\text{C}[\text{CH}_3]=\text{NOCH}_3$ - C_6H_3	WO-A 93/15,046
I.8A-7	2- CH_3 , 4- $\text{C}[\text{CH}_3]=\text{NOCH}_2\text{CH}_3$ - C_6H_3	WO-A 93/15,046
I.8A-8	2- CH_3 , 4- $\text{C}[\text{CH}_2\text{CH}_3]=\text{NOCH}_3$ - C_6H_3	WO-A 93/15,046
I.8A-9	2- CH_3 , 4- $\text{C}[\text{CH}_2\text{CH}_3]=\text{NOCH}_2\text{CH}_3$ - C_6H_3	WO-A 93/15,046
I.8A-10	1-[4-Cl- C_6H_4]- 吡啶 -3- 基	DE-A 44 23 612.3

表 I.8B

式 IA 化合物，其中 Q 是苯基，R' 是 $-\text{N}(\text{OCH}_3)-\text{CO}_2\text{CH}_3$ ，n 是 0，R'' 是 $\text{CH}_2\text{ON}=\text{CR}^\alpha\text{R}^\beta$ ，其中 R^α 和 R^β 有下列含义：

序号	R^α	R^β	参考文献
I.8B-1	CH_3	3,5- Cl_2 - C_6H_3	WO-A 93/15,046

为了产生协同增效作用，将喹螨醚与活性成分 I 以 20：1 至 1：20，



优选 10: 1 至 1: 10 的重量比使用。

本发明还涉及控制有害真菌的方法，该方法包括用上面定义的组合物处理真菌及其周围环境，或处理要防止真菌感染的材料，植物，种子，土壤，区域或空间，可以同时即联合或分别地或者连续地使用活性成分 I。

本发明组合物可以，例如，可以直接喷洒的溶液，粉末或悬浮液使用，也可以高浓度水性，油性或其它形式的悬浮液或分散液，乳液，油分散液，糊，细粉，播撒物或通过喷洒，喷雾，扬撒，播撒或倾倒方式使用的颗粒。所采用的形式取决于所要达到的目的；在任何情况下，它们应该保证本发明活性成分尽可能均匀分布。

通常，将活性成分喷洒或扬撒在植物上或用活性成分处理植物种子。

制剂是用已知方法制备，例如，用溶剂和/或载体，如果需要，用乳化剂和分散剂扩容活性成分，如果用水作为稀释剂，还可以用其它有机溶剂作辅助溶剂。适合的辅剂主要是：溶剂，如芳香烃类（如二甲苯），氯代芳香烃类（如氯苯），石蜡（如矿物油馏分），醇（如甲醇，丁醇），酮（如环己酮），胺（如乙醇胺，二甲基甲酰胺）和水；载体，如研磨的天然矿物质（如高岭土，粘土，滑石，石膏）和研磨的合成矿物质（如高分散性氧化硅，硅酸盐）；乳化剂，如非离子和阴离子乳化剂（如聚氧乙烯脂肪醇醚，烷基磺酸酯和芳基磺酸酯）和分散剂，如木素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

适合的表面活性剂是碱金属，碱土金属和芳香族磺酸的铵盐，如木素-，苯酚-，萘-和二丁基萘-磺酸和脂肪酸的铵盐，烷基-和烷基芳基-磺酸盐，烷基硫酸盐，月桂基醚硫酸盐和脂肪醇硫酸盐；硫酸化的十六-，十七-和十八-醇盐，及脂肪醇乙二醇醚，磺酸化的萘及其衍生物与甲醛的缩合物，萘或萘磺酸与苯酚和甲醛的缩合物，聚氧乙烯辛基苯基醚，乙氧基化的异辛基-，辛基-或壬基-苯酚，烷基苯基聚乙二醇醚和三丁基苯基聚乙二醇醚，烷基芳基聚醚醇，异十三醇，脂肪醇/环氧乙烷缩合物，乙氧基化的蓖麻油，聚氧乙烯烷基醚或聚氧丙烯烷基醚，月桂醇聚乙二醇醚乙酸酯，山梨醇酯，木素亚硫酸盐废液或甲基纤维素。

粉剂，播撒物和细粉可以通过混合或活性成分和固体载体一起研磨来制备。



颗粒，如包衣颗粒，浸渍颗粒和匀化颗粒，可以通过将活性成分结合到固体载体上来制备。固体载体有矿物质，如硅胶，氧化硅，硅胶，硅酸盐，滑石，高岭土，石灰石，石灰，石膏，红玄武土，黄土，粘土，白云石，硅藻土，硫酸钙和硫酸镁，氧化镁，研磨的合成物质，肥料如硫酸铵，磷酸铵，硝酸铵，尿素，以及源于植物的产物，如谷粉，树皮粉，木粉和坚果壳粉，纤维素粉，或其它固体载体。这种制剂含有活性成分的重量比为 1: 1，例如：

I. 90 重量份活性成分和 10 重量份 N - 甲基吡咯烷酮形成的溶液，适用于微滴(microdrop)形式；

II. 20 重量份活性成分， 80 重量份二甲苯， 10 重量份 8 - 10mol 环氧乙烷与 1mol 油酸 N - 一乙醇酰胺构成的加合物， 5 重量份十二烷基苯磺酸钙， 5 重量份 40mol 环氧乙烷与 1mol 蓖麻油构成的加合物所形成的混合物；将溶液细分散在水中，得到分散液；

III. 由 20 重量份活性成分， 40 重量份环己酮， 30 重量份异丁醇， 20 重量份 40mol 环氧乙烷与 1mol 蓖麻油构成的加合物形成的水性分散液；

IV. 由 20 重量份活性成分， 25 重量份环己醇， 65 重量份沸点为 210 - 280 ℃的矿物油馏分， 10 重量份 40mol 环氧乙烷与 1mol 蓖麻油构成的加合物形成的水性分散液；

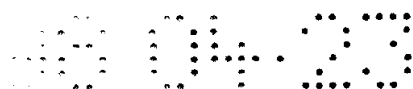
V. 80 重量份活性成分， 3 重量份二异丁基萘基 - 1 - 磺酸钠， 10 重量份从硫化物废液中得到的木素磺酸钠盐， 7 重量份粉状硅胶，在锤式研磨机中研磨形成混合物；将混合物细分散在水中，得到喷洒用混合物；

VI. 3 重量份活性成分和 97 重量份精心分离的高岭土构成紧密混合的混合物；这种细粉含有 3 % 重量活性成分；

VII. 30 重量份活性成分， 92 重量份粉状硅胶和 8 重量份已经喷洒在硅胶表面的石蜡油构成紧密混合的混合物；这种制剂对活性成分有较好的粘性；

VIII. 40 重量份活性成分， 10 重量份苯基磺酸钠盐/尿素/甲醛缩合物， 2 重量份硅胶和 48 重量份水构成稳定的水性分散液，这种分散液可以进一步稀释；

IX. 20 重量份活性成分， 2 重量份十二基苯磺酸钙， 8 重量份脂肪醇聚乙



二醇醚，20重量份苯酚磺酸/尿素/甲醛缩合物的钠盐和88重量份石蜡矿物油构成稳定的水或油性分散液。

本发明组合物的特征在于其对植物致病真菌，尤其是葡萄孢属真菌具有突出的广谱杀菌活性。由于它们中的一些是系统作用（即，无任何活性损失地被植物吸收，并可以在植物中易位），因此它们可被用作对叶片和土壤作用的杀真菌剂。

它们对控制多种农作物的大量真菌感染显得尤为重要，这些农作物包括小麦，黑麦，大麦，燕麦，稻子，玉米，草，棉，大豆，咖啡，甘蔗，葡萄，水果类，观赏植物和蔬菜类，如瓜类，菜豆类和葫芦类，以及这些植物的种子。

利用杀真菌活性量的活性成分处理真菌，或防止感染真菌的种子，植物，材料或土壤来施涂组合物。

在材料，植物或种子被真菌感染之前或之后使用组合物都有效果。

尤其是，该组合物适于控制下列植物病：谷类的禾白粉菌（粉霉）病，葫芦类的二孢白粉菌和苍耳单丝壳菌病，苹果类的苹果白粉病柄球菌病，葡萄类的葡萄白粉病钩丝壳菌病，苹果类的苹果黑星菌（疤）病，谷类的长蠕孢类病，小麦的小麦颖枯病，草莓和葡萄类的灰色葡萄孢（灰色霉菌）病，落花生类的花生尾孢病，小麦和大麦的假尾孢菌(*Pseudocercospora*) *herpotrichoides* 病，水稻的 *Pyricularia oryzae* 病，各种植物的镰孢属和轮枝孢属类病，蔬菜和水果的链格孢属类病，水果的链核盘菌属类病，及油菜和蔬菜的核盘菌属类病。

优选用于杀葡萄孢属。

该组合物也可以用来保护材料（如木材）不受，例如，宛氏拟青霉侵害。

杀真菌组合物一般含有 0.1 - 95 %，优选 0.5 - 90 % 重量活性成分。

根据所要达到的效果每公顷使用活性成分的量 0.02 - 3kg。

对于种子处理，一般每公斤种子需要用 0.001 - 50g，优选 0.01 - 10g 活性成分。

在作为杀真菌剂使用时本发明组合物还可以含有其它活性成分，如除草剂，杀虫剂，生长调节剂，杀真菌剂或其它肥料。



混合使用杀真菌剂常常能拓宽杀真菌剂的广谱作用。

下列与本发明化合物一起使用的杀真菌剂可以用来说明结合使用的可能性，但没有任何限制作用：

硫，

二硫代碳酸盐及其衍生物，如二甲基二硫代氨基甲酸铁（III），二甲基二硫代氨基甲酸锌，亚乙基双二硫代氨基甲酸锌，亚乙基双二硫代氨基甲酸锰，乙二胺双二氨基甲酸锌锰，二硫化四甲基秋兰姆，（N,N-亚乙基双二硫代氨基甲酸锌）的氮复合物，锌（N,N'-亚丙基双二硫代氨基甲酸锌）的氮复合物，（N,N'-亚丙基双二硫代氨基甲酸）锌，N,N'-聚丙烯双（硫代氨基甲酰基）二硫化物，

硝基衍生物，如二硝基（1-甲基庚基）苯基丁烯酸酯，2-仲丁基-4,6-二硝基苯基-3,3-二甲基丙烯酸酯，2-仲丁基-4,6-二硝基苯基异丙基碳酸酯，5-硝基异邻苯二甲酸二异丙酯；

杂环物，如2-十七烷基-2-咪唑啉乙酸酯，2,4-二氯-6-（邻氯苯胺基）-s-三嗪，邻苯二甲酰亚胺硫代磷酸O,O-二乙酯，5-氨基-1-[双（二甲氨基）氧磷基]-3-苯基-1,2,4-三唑，2,3-二氯基-1,4-二硫代蒽醌，2-硫代-1,3-二硫羧并[4,5-b]喹啉，1-（丁基氨基甲酰基）-2-苯并咪唑氨基甲酸甲酯，2-甲氧羰基氨基苯并咪唑，2-（呋喃基-(2)）苯并咪唑，2-（噻唑基-(4)）苯并咪唑，N-（1,1,2,2-四氯乙硫基）四氢邻苯二甲酰亚胺，N-三氯甲硫基四氢邻苯二甲酰亚胺，N-三氯甲硫基邻苯二甲酰亚胺，N-二氯氧甲硫基-N,N'-二甲基-N-苯基硫联氨，5-乙氧基-3-三氯甲基-1,2,3-噻二唑，2-硫代氧氧基甲硫基苯并噻唑，1,4-二氯-2,5-二甲氧基苯，4-（2-氯苯基亚胍基）-3-甲基-5-异噻唑酮，吡啶-2-硫醇1-氧化物，8-羟基喹啉或其铜盐，2,3-二氢-5-羧酰苯氨基-6-甲基-1,4-氧硫杂环己二烯，2,3-二氢-5-羧酰苯氨基-6-甲基-1,4-氧硫杂环己二烯4,4-二氧化物，2-甲基-5,6-二氢-4H-呋喃-3-羧酰苯胺，2-甲基呋喃-3-羧酰苯胺，2,5-二甲基呋喃-3-羧酰苯胺，2,4,5-三甲基呋喃-3-羧酰苯胺，N-环己基-2,5-二甲基呋喃-3-羧酰胺，N-环己基-N-甲氧基-2,5-二甲基呋喃-3-羧

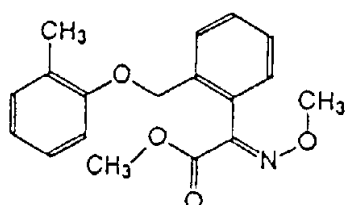
酰胺, 2-甲基苯甲酰苯胺, 2-碘苯甲酰苯胺, N-甲酰基-N-吗啉-2,2,2-三氯乙基乙酸酯, 哌嗪-1,4-二基双[1-(2,2,2-三氯乙基)]甲酰胺, 1-(3,4-二氯苯氧基)-1-甲酰氨基-2,2,2-三氯乙烷, 2,6-二甲基-N-十三烷基-吗啉或其盐, 2,6-二甲基-N-环十二烷基-吗啉或其盐, N-[3-(对-叔丁基苯基)-2-甲基丙基]-顺-2,6-二甲基吗啉, N-[3-(对-叔丁基苯基)-2-甲基丙基]哌啶, 1-[2-(2,4-二氯苯基)-4-乙基-1,3-二氧戊环-2-基-乙基]-1H-1,2,4-三唑, 1-[2-(2,4-二氯苯基)-4-正丙基-1,3-二氧戊环-2-基-乙基]-1H-1,2,4-三唑, N-(正丙基)-N-(2,4,6-三氯苯氧基乙基)-N'-咪唑基-脲, 1-(4-氯苯氧基)-3,3-二甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-2-丁酮, 1-(4-氯苯氧基)-3,3-二甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-2-丁醇, α -(2-氯苯基)- α -(4-氯苯基)-5-嘧啶甲醇, 5-丁基-2-二甲氨基-4-羟基-4-甲基嘧啶, 双-(对-氯苯基)-3-吡啶甲醇, 1,2-双-(3-乙氧羰基-2-硫脲基)苯, 1,2-双-(3-甲氧羰基-2-硫脲基)苯, 及

各种杀真菌剂, 如十二烷基胍乙酸盐, 3-[3-(3,5-二甲基)-2-氧基环己基-2-羟乙基]戊二酰亚胺及六氯苯, N-(2,6-二甲基苯基)-N-(2-呋喃甲酰基)-DL-丙氨酸甲酯, DL-N-(2,6-二甲基苯基)-N-(2'-甲氧基乙酰基)-丙氨酸甲酯, N-(2,6-二甲基苯基)-N-氯乙酰基-D,L-2-氨基丁内酯, DL-N-(2,6-二甲基苯基)-N-(苯基乙酰基)-丙氨酸甲酯, 5-甲基-5-乙烯基-3-(3,5-二氯苯基)-2,4-二氧代-1,3-噁唑烷, 3-[3,5-二氯苯基-(5-甲基-5-甲氧基甲基)]-1,3-噁唑烷-2,4-二酮, 3-(3,5-二氯苯基)-1-异丙基氨基甲酰基乙内酰脲, N-(3,5-二氯苯基)-1,2-二甲基环丙烷-1,2-羧酰亚胺, 2-氟基-[N-(乙氧基羰基)-2-甲氧基亚氨基]乙酰胺, 1-[2-(2,4-二氯苯基)戊基]-1H-1,2,4-三唑, 2,4-二氯- α -(1H-1,2,4-三唑基-1-甲基)二苯甲基醇, N-(3-氯-2,6-二硝基-4-三氟甲基苯基)-5-三氟甲基-3-氯-2-氨基吡啶, 1-[双(4-氯苯基)甲基甲

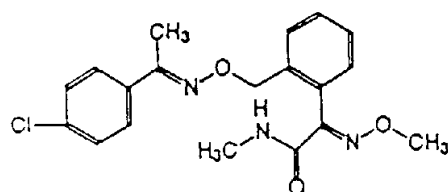
硅烷基]甲基 - 1H - 1,2,4 - 三唑。

本发明组合物的协同增效作用用下列实施例加以说明, 其中式 I.1 - I.7 的化合物被用作活性成分 I。

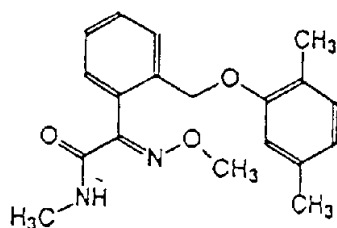
I.1



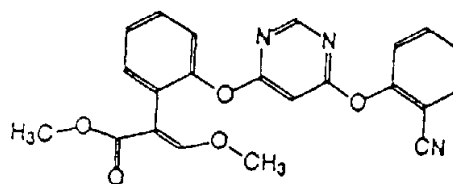
I.2



I.3



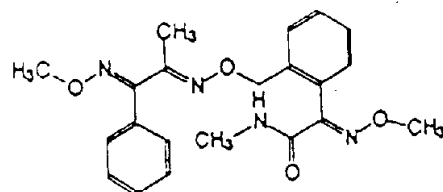
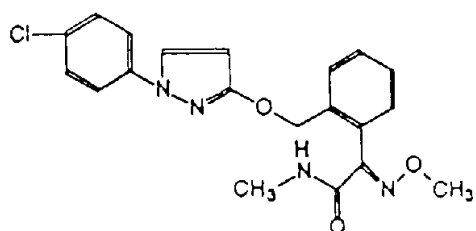
I.4

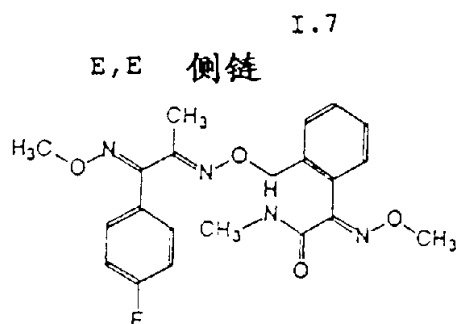


I.5

I.6

E,E 异构体 (含有 5% 的 Z,E 异构体)





应用实施例 1

杀钟形胡椒(bell peppers)上面的灰色葡萄孢菌的活性

将活性成分的水剂滴洒到绿色钟形胡椒的果盘中，水剂含有 80 % 活性成分和 20 % 干乳化剂。全面滴洒（整个包住胡椒）的水剂干了 2 小时之后将每毫升 2 % 浓度 Biomalz 溶液含有 1.7×10^6 灰色葡萄孢子的孢子悬浮液接种到果盘上。随后将接种的果盘在 18 °C 潮湿箱中培养 4 天。然后直接观察葡萄孢菌在患病果盘上的发展情况（患病率 99 %）。

将观察测定的数据即患病果实面积的百分比转换成相对于未处理对照组的百分比效能。效能为 0 说明与未处理对照组有相同的患病率，效能为 100 说明患病率为 0。联合方式使用活性成分预计的效能用 Colby 公式计算（Colby, S.R., “联合使用除草剂产生的增效和拮抗作用的计算” (Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide Combinations), 《杂草》(Weeds), 15, pp.20-22, 1967), 并与实测效能比较, 结果列于下面表 1。

表 1

活性化合物	活性化合物浓度(ppm)		对比活性值(%)	
	喹螨醚	活性化合物 I.1	实测值	计算值*)
对照组 (未处理的)	---	---	0	
喹螨醚	250	---	19	
	125	---	0	
I.1	---	63	79	
	---	31	74	
	---	16	19	
喹螨醚 + I.1	250	63	99	83
	250	31	85	79

*) 根据 Colby 公式计算



试验结果表明所有混合比例的实测效能都超过事先用 Colby 公式计算的加和效能，即具有增效作用。

应用实施例 2

杀灰色葡萄孢菌的活性

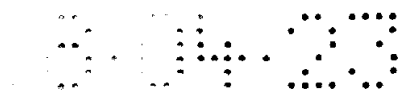
经过适当培养用“Neusiedler Ideal Elite”方法种植的胡椒已经长到 4 - 5 个叶片。将活性成分的水悬浮液滴洒到上面，水剂含有 80 % 活性成分和 20 % 干乳化剂。全面滴洒（整个包住）的水剂干了后在植物上喷洒灰色葡萄孢真菌的分生孢子悬浮液，然后将其放入 22 - 24 °C 的高湿度箱中。5 天后未处理对照组植物染上的疾病已经发展到大部分叶子枯死（患病率 83 %）。

将观察测定的数据即患病果实面积的百分比转换成相对于未处理对照组的百分比效能。效能为 0 说明与未处理对照组有相同的患病率，效能为 100 说明患病率为 0。联合方式使用活性成分预计的效能用 Colby 公式计算（Colby, S.R., “联合使用除草剂产生的增效和拮抗作用的计算” (Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide Combinations), 《杂草》(Weeds), 15, pp.20-22, 1967), 并与实测效能比较，结果列于下面表 2。

表 2

活性化合物	活性化合物浓度(ppm)		对比活性值(%)	
	喹啉醚	活性化合物 I.1	实测值	计算值*)
对照组 (未处理的)	---	---	0	
喹啉醚	500	---	4	
	250	---	4	
I.1	---	63	28	
	---	31	16	
喹啉醚 + I.1	500	63	88	33
	250	31	70	19

*) 根据 Colby 公式计算。



试验结果表明所有混合比例的实测效能都超过事先用 Colby 公式计算的加和效能，即具有增效作用。

应用实施例 3

杀在钟形胡椒上面的灰色葡萄孢菌的活性

采用应用实施例 1 所述方法，用下面表 3 所列化合物得到以下结果。

表 3

活性化合物	活性化合物浓度(ppm)		对比活性值(%)	
	I.1-I.7	喹螨醚 II	实测值	计算值*)
对照组 (未处理的)	--	--	0	
喹螨醚 II	--	500 250 50 25	0 0 0 0	--
I.2	50 25	--	95 89	--
I.3	50 25	--	79 28	--
I.4	50 25	--	15 34	--
I.5	50	--	60	--
I.6	50 25	--	47 47	--
I.7	50 25	--	34 42	--
I.2 + II	25 25	250 25	100 95	89 89
I.3 + II	25 25	250 25	100 79	28 28
I.4 + II	25 25	250 25	79 66	34 34
I.5 + II	25 50	250 50	97 79	73 60
I.6 + II	25 25	250 25	97 76	47 47
I.7 + II	25 25	250 25	97 84	42 42

*) 根据 Colby 公式计算。



试验结果表明所有混合比例的实测效能都超过事先用 Colby 公式计算的加和效能，即具有增效作用。

应用实施例 4

杀灰色葡萄孢菌的活性

采用应用实施例 1 所述方法，用下面表 4 所列化合物得到以下结果。

表 4

活性化合物	活性化合物浓度(ppm)		对比活性值(%)	
	I.1-I.7	喹螨醚 II	实测值	计算值*)
对照组 (未处理的)			0	
喹螨醚 II		500	48	--
		250	27	
		50	34	
		25	17	
I.2	25	--	0	--
I.3	25	--	34	--
I.4	50	--	0	--
	25		0	
I.5	50	--	0	--
	25		0	
I.6	50	--	52	--
	25		72	
I.7	25	--	62	
I.2 + II	25	25	59	17
I.3 + II	25	25	65	46
I.4 + II	50	500	90	48
	25	250	79	27
	50	50	52	34
	25	25	55	17
I.5 + II	50	50	52	34
	25	25	52	17
I.6 + II	50	500	97	75
	25	250	90	80
	50	50	86	68
	25	25	86	77
I.7 + II	25	25	90	68

*) 根据 Colby 公式计算。

试验结果表明所有混合比例的实测效能都超过事先用 Colby 公式计算的加和效能，即具有增效作用。

将上面表 I.1 - I.8 所述的其它各化合物用于上述实验可以得到类似的结果。