



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 112888682 A

(43) 申请公布日 2021.06.01

(21) 申请号 201980068742.9

(22) 申请日 2019.10.17

(30) 优先权数据

18201294.8 2018.10.18 EP

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2021.04.16

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/EP2019/078252 2019.10.17

(87) PCT国际申请的公布数据

W02020/079167 EN 2020.04.23

(71) 申请人 拜耳公司

地址 德国勒沃库森

(72) 发明人 P·克里斯托 P·德斯博德斯

J·杜弗尔 M·古尔格斯

D·洛克 S·诺德 V·托马斯

(74) 专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司 11285

代理人 杨月 钟守期

(51) Int.Cl.

*C07D 401/14* (2006.01)

*A01N 43/42* (2006.01)

*A01N 43/56* (2006.01)

*C07D 403/14* (2006.01)

*C07D 409/14* (2006.01)

权利要求书4页 说明书71页

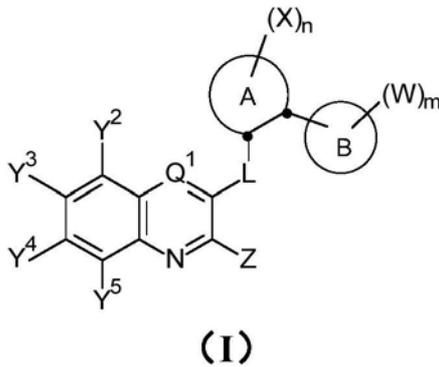
(54) 发明名称

杂芳基氨基喹啉和类似物

(57) 摘要

本公开涉及杀真菌活性化合物,更具体地涉及杂芳基氨基喹啉及其类似物,用于制备其的方法和中间体,及其作为杀真菌活性化合物、特别是以杀真菌剂组合物形式的用途。本公开还涉及使用这些化合物或包含它们的组合物防治植物的植物病原性真菌的方法。

1. 式 (I) 的化合物及其盐、N-氧化物、金属络合物、类金属络合物和光学活性异构体或几何异构体:



其中

- A为5或6元不饱和杂环基环,其包含1、2或3个独立地选自N、O和S的杂原子,其中环A的分别连接至基团B和基团L的两个连接点是相邻碳原子;

- B为部分饱和的或不饱和的5元杂环基环,其包含1、2、3或4个独立地选自N、O和S的杂原子;

- $Q^1$ 为 $CY^1$ 或N,其中:

$Y^1$ 选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_2-C_8$ -烯基、包含最高达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、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_2-C_8$ -卤代炔基、 $C_3-C_7$ -环烷基、 $C_4-C_7$ -环烯基、羟基、 $C_1-C_8$ -烷氧基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷氧基、甲酰基、氨基、 $C_1-C_8$ -烷基氨基、二- $C_1-C_8$ -烷基氨基、硫烷基、 $C_1-C_8$ -烷基硫烷基、 $C_1-C_8$ -烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$ -烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ -三烷基甲硅烷基、氰基和硝基,

其中所述 $C_3-C_7$ -环烷基或 $C_4-C_7$ -环烯基可被一个或多个 $Y^a$ 取代基取代;

- $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$ 和 $Y^5$ 独立地选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_2-C_8$ -烯基、包含最高达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、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_2-C_8$ -卤代炔基、 $C_3-C_7$ -环烷基、 $C_4-C_7$ -环烯基、羟基、 $C_1-C_8$ -烷氧基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷氧基、甲酰基、氨基、 $C_1-C_8$ -烷基氨基、二- $C_1-C_8$ -烷基氨基、硫烷基、 $C_1-C_8$ -烷基硫烷基、 $C_1-C_8$ -烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$ -烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ -三烷基甲硅烷基、氰基和硝基,

其中所述 $C_3-C_7$ -环烷基或 $C_4-C_7$ -环烯基可被一个或多个 $Y^a$ 取代基取代;

- Z选自氢原子、卤素原子、羟基、 $C_1-C_8$ -烷基、 $C_2-C_8$ -烯基、 $C_2-C_8$ -炔基、包含最高达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、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_2-C_8$ -卤代烯基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷氧基、 $C_3-C_7$ -环烷基、 $C_4-C_7$ -环烯基、甲酰基、 $C_1-C_8$ -烷基氨基、二- $C_1-C_8$ -烷基氨基、硫烷基、 $C_1-C_8$ -烷基硫烷基、 $C_1-C_8$ -烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$ -烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ -三烷基甲硅烷基、氰基和硝基;

其中所述 $C_3-C_7$ -环烷基或 $C_4-C_7$ -环烯基可被一个或多个 $Z^a$ 取代基取代;

- m为0、1、2、3或4;

- n为0、1、2或3；
- L为CR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>或NR<sup>3</sup>，其中

R<sup>1</sup>和R<sup>2</sup>独立地选自氢原子、卤素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基和C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基，

R<sup>3</sup>选自氢原子、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-烯基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-炔基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-卤代炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-环烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-卤代环烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-环烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基羰基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烷基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基羰基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基磺酰基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烷基磺酰基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基和苯基磺酰基，

其中所述C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-环烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-环烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基和苯基磺酰基可被一个或多个R<sup>3a</sup>取代基取代；

• W独立地选自卤素原子、羟基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-羟基烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-烯基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-炔基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-卤代炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>-环烯基、芳基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂环基、杂环基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳氧基、杂芳氧基、芳基硫烷基、芳基亚磺酰基、芳基磺酰基、杂芳基硫烷基、杂芳基亚磺酰基、杂芳基磺酰基、芳基氨基、杂芳基氨基、芳氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基硫烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基亚磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳基硫烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳基亚磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳基磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基氨基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳基氨基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫烷基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基亚磺酰基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基磺酰基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫烷基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基亚磺酰基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基磺酰基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基、甲酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基羰基、(羟基亚氨基)C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基亚氨基)C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、羧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基羰基、氨基甲酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基甲酰基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基甲酰基、氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基、硫烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-三烷基甲硅烷基、三(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)甲硅烷氧基、三(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)甲硅烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、氰基和硝基，

其中所述C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>-环烯基、杂环基、芳基以及以下基团的芳基、杂环基和杂芳基部分可被一个或多个W<sup>a</sup>取代基取代：芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂环基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳氧基、杂芳氧基、芳基硫烷基、芳基亚磺酰基、芳基磺酰基、杂芳基硫烷基、杂芳基亚磺酰基、杂芳基磺酰基、芳基氨基、杂芳基氨基、芳氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基硫烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基亚磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳基硫烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳基亚磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳基磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基氨基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳基氨基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫烷基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基亚磺酰基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基磺酰基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫烷基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基亚磺酰基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基磺酰基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基；

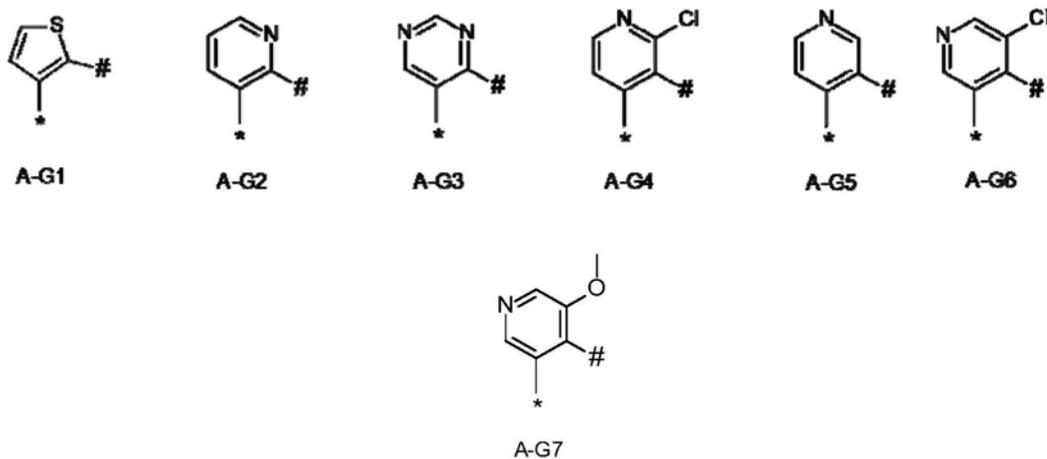
• X独立地选自卤素原子、羟基、 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷氧基、 $C_2-C_8$ -烯基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_2-C_8$ -卤代烯基、 $C_2-C_8$ -炔基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_2-C_8$ -卤代炔基、 $C_3-C_7$ -环烷基、 $C_4-C_7$ -环烯基、甲酰基、氨基、 $C_1-C_8$ -烷基氨基、二- $C_1-C_8$ -烷基氨基、硫烷基、 $C_1-C_8$ -烷基硫烷基、 $C_1-C_8$ -烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$ -烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ -三烷基甲硅烷基、氰基、硝基和 $C_1-C_8$ -羟基烷基，

其中所述 $C_3-C_7$ -环烷基或 $C_4-C_7$ -环烯基可被一个或多个 $X^a$ 取代基取代；

$Z^a$ 、 $R^{3a}$ 、 $W^a$ 、 $X^a$ 和 $Y^a$ 独立地选自卤素原子、硝基、羟基、氰基、羧基、氨基、硫烷基、五氟- $\lambda^6$ -硫烷基、甲酰基、氨基甲酰基、氨基甲酸酯基、 $C_1-C_8$ -烷基、 $C_3-C_7$ -环烷基、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 $C_3-C_8$ -卤代环烷基、 $C_2-C_8$ -烯基、 $C_2-C_8$ -炔基、 $C_1-C_8$ -烷基氨基、二- $C_1-C_8$ -烷基氨基、 $C_1-C_8$ -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷氧基、 $C_1-C_8$ -烷基硫烷基、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基硫烷基、 $C_1-C_8$ -烷基羰基、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基羰基、 $C_1-C_8$ -烷基氨基甲酰基、二- $C_1-C_8$ -烷基氨基甲酰基、 $C_1-C_8$ -烷氧基羰基、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷氧基羰基、 $C_1-C_8$ -烷基羰氧基、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基羰氧基、 $C_1-C_8$ -烷基羰基氨基、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基羰基氨基、 $C_1-C_8$ -烷基硫烷基、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基硫烷基、 $C_1-C_8$ -烷基亚磺酰基、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$ -烷基磺酰基和具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代-烷基-磺酰基。

2. 根据权利要求1所述的式(I)的化合物，其中A选自噻吩基、吡啶基和嘧啶基。

3. 根据权利要求1所述的式(I)的化合物，其中A选自A-G1、A-G2、A-G3、A-G4、A-G5、A-G6和A-G7：



其中“\*”表示连接至L，“#”表示连接至B。

4. 根据前述权利要求中任一项所述的式(I)的化合物，其中B为噻吩基或吡啶基。

5. 根据前述权利要求中任一项所述的式(I)的化合物，其中L为 $CR^1R^2$ ，其中 $R^1$ 和 $R^2$ 为氢原子，或L为 $NR^3$ ，其中 $R^3$ 为氢原子。

6. 根据前述权利要求中任一项所述的式(I)的化合物，其中X独立地选自卤素原子、 $C_1-C_6$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷基、羟基、 $C_1-C_6$ -烷氧基和包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷氧基。

7. 根据前述权利要求中任一项所述的式 (I) 的化合物, 其中  $n$  为 0 或 1。
8. 根据前述权利要求中任一项所述的式 (I) 的化合物, 其中  $W$  独立地选自卤素原子、 $C_1-C_6$ -烷基、包含最高达 9 个可以相同或不同的卤素原子的  $C_1-C_6$ -卤代烷基、 $C_1-C_6$ -羟基烷基、 $C_2-C_6$ -烯基、 $C_1-C_6$ -烷氧基羰基、 $C_3-C_7$ -环烷基、芳基、芳基- $C_1-C_6$ -、杂环基、羧基、三 ( $C_1-C_6$ -烷基) 甲硅烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基、杂芳基- $C_1-C_6$ -烷基和  $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基。
9. 根据前述权利要求中任一项所述的式 (I) 的化合物, 其中  $W$  为  $C_1-C_6$ -烷基或  $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基。
10. 根据前述权利要求中任一项所述的式 (I) 的化合物, 其中  $m$  为 0 或 1。
11. 根据前述权利要求中任一项所述的式 (I) 的化合物, 其中  $Z$  为氢原子或  $C_1-C_6$ -烷基。
12. 根据前述权利要求中任一项所述的式 (I) 的化合物, 其中  $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$  和  $Y^5$  独立地为氢原子或卤素原子。
13. 根据前述权利要求中任一项所述的式 (I) 的化合物, 其中  $Q^1$  为  $CY^1$  或  $N$ , 其中  $Y^1$  选自氢、卤素和  $C_1-C_8$ -烷基。
14. 组合物, 其包含至少一种根据权利要求 1 至 13 中任一项所述的式 (I) 的化合物和至少一种农业上合适的助剂。
15. 一种防治不想要的植物病原性微生物的方法, 其包括将一种或多种根据权利要求 1 至 13 中任一项所述的式 (I) 的化合物或根据权利要求 14 所述的组合物施用至植物、植物部位、种子、果实或植物生长的土壤的步骤。

## 杂芳基氨基喹啉和类似物

### 技术领域

[0001] 本公开涉及杀真菌活性化合物,更具体地涉及杂芳基氨基喹啉及其类似物,用于制备其的方法和中间体,及其作为杀真菌活性化合物、特别是以杀真菌剂组合物形式的用途。本公开还涉及使用这些化合物或包含它们的组合物防治植物的植物病原性真菌的方法。

### 背景技术

[0002] WO 2011/081174和WO 2012/161071公开了适合用作杀真菌剂的含氮杂环化合物。

[0003] WO 2013/058256公开了适合用作杀真菌剂的其他含氮杂环化合物。

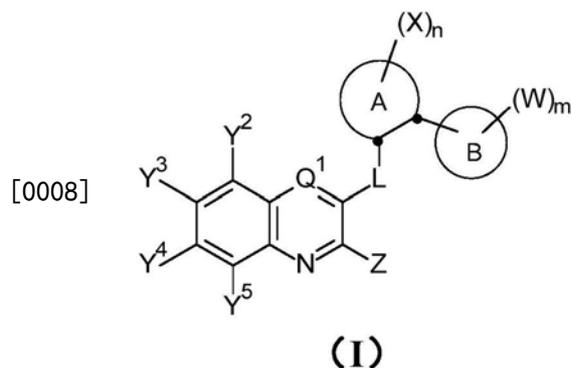
[0004] 然而,由于对杀真菌剂活性化合物的生态要求和经济要求不断增加,例如关于活性谱、毒性、选择性、施用率、残留物的形成和有利的制造的要求,并且由于还可能存在着与抗性相关的问题,因此持续需要开发至少在这些方面中的某些方面比已知化合物和组合物具有优势的新的杀真菌化合物和组合物。

### 发明内容

[0005] 因此,本发明提供如本文在下文中记载的杂芳基氨基喹啉及其类似物,其可用作杀微生物剂、优选用作杀真菌剂。

#### [0006] 活性成分

[0007] 本发明提供式(I)的化合物及其盐、N-氧化物、金属络合物、类金属络合物和光学活性异构体或几何异构体,



[0009] 其中

[0010] • A为5或6元不饱和杂环基环,其包含1、2或3个独立地选自N、O和S的杂原子,其中环A的分别连接至基团B和基团L的两个连接点是相邻碳原子(表示为●);

[0011] • B为部分饱和的或不饱和的5元杂环基环,其包含1、2、3或4个独立地选自N、O和S的杂原子;

[0012] • Q<sup>1</sup>为CY<sup>1</sup>或N,其中: Y<sup>1</sup>选自氢原子、卤素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-烯基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-炔基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-

卤代炔基、 $C_3-C_7$ -环烷基、 $C_4-C_7$ -环烯基、羟基、 $C_1-C_8$ -烷氧基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷氧基、甲酰基、氨基、 $C_1-C_8$ -烷基氨基、二- $C_1-C_8$ -烷基氨基、硫烷基、 $C_1-C_8$ -烷基硫烷基、 $C_1-C_8$ -烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$ -烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ -三烷基甲硅烷基、氰基和硝基，

[0013] 其中所述 $C_3-C_7$ -环烷基或 $C_4-C_7$ -环烯基可被一个或多个 $Y^a$ 取代基取代；

[0014] •  $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$ 和 $Y^5$ 独立地选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_2-C_8$ -烯基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_2-C_8$ -卤代炔基、 $C_2-C_8$ -炔基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_2-C_8$ -卤代炔基、 $C_3-C_7$ -环烷基、 $C_4-C_7$ -环烯基、羟基、 $C_1-C_8$ -烷氧基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷氧基、甲酰基、氨基、 $C_1-C_8$ -烷基氨基、二- $C_1-C_8$ -烷基氨基、硫烷基、 $C_1-C_8$ -烷基硫烷基、 $C_1-C_8$ -烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$ -烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ -三烷基甲硅烷基、氰基和硝基，

[0015] 其中所述 $C_3-C_7$ -环烷基或 $C_4-C_7$ -环烯基可被一个或多个 $Y^a$ 取代基取代；

[0016] • Z选自氢原子、卤素原子、羟基、 $C_1-C_8$ -烷基、 $C_2-C_8$ -烯基、 $C_2-C_8$ -炔基、包含最高达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、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_2-C_8$ -卤代炔基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷氧基、 $C_3-C_7$ -环烷基、 $C_4-C_7$ -环烯基、甲酰基、 $C_1-C_8$ -烷基氨基、二- $C_1-C_8$ -烷基氨基、硫烷基、 $C_1-C_8$ -烷基硫烷基、 $C_1-C_8$ -烷基亚磺酰基、 $C_1-C_8$ -烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ -三烷基甲硅烷基、氰基和硝基；

[0017] 其中所述 $C_3-C_7$ -环烷基或 $C_4-C_7$ -环烯基可被一个或多个 $Z^a$ 取代基取代；

[0018] • m为0、1、2、3或4；

[0019] • n为0、1、2或3；

[0020] • L为 $CR^1R^2$ 或 $NR^3$ ，其中

[0021]  $R^1$ 和 $R^2$ 独立地选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_8$ -烷氧基和 $C_1-C_8$ -烷基， $R^3$ 选自氢原子、 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_2-C_8$ -烯基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_2-C_8$ -卤代炔基、 $C_3-C_8$ -炔基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_3-C_8$ -卤代炔基、 $C_3-C_7$ -环烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_3-C_7$ -卤代环烷基、 $C_3-C_7$ -环烷基- $C_1-C_8$ -烷基、 $C_1-C_8$ -烷基羰基、包含最高达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、包含最高达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、 $C_1-C_8$ -烷基磺酰基、包含最高达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、芳基- $C_1-C_8$ -烷基和苯基磺酰基，其中所述 $C_3-C_7$ -环烷基、 $C_3-C_7$ -环烷基- $C_1-C_8$ -烷基、芳基- $C_1-C_8$ -烷基和苯基磺酰基可被一个或多个 $R^{3a}$ 取代基取代；

[0022] • W独立地选自卤素原子、羟基、 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷氧基、 $C_1-C_8$ -羟基烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_1-C_8$ -烷基、 $C_2-C_8$ -烯基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_2-C_8$ -卤代炔基、 $C_2-C_8$ -炔基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_2-C_8$ -卤代炔基、 $C_3-C_7$ -环烷基、 $C_4-C_8$ -环烯基、芳基、芳基- $C_1-C_8$ -烷基、杂环基、杂环基- $C_1-C_8$ -烷基、芳氧基、杂芳氧基、芳基硫烷基、芳基亚磺酰基、芳基磺酰基、杂芳基

硫烷基、杂芳基亚磺酰基、杂芳基磺酰基、芳基氨基、杂芳基氨基、芳氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基硫烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基亚磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳基硫烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳基亚磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳基磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基氨基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳基氨基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫烷基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基亚磺酰基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基磺酰基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫烷基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基亚磺酰基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基磺酰基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基、甲酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基羰基、(羟基亚氨基)C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基亚氨基)C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、羧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基羰基、氨基甲酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基甲酰基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基甲酰基、氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基、硫烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-三烷基甲硅烷基、三(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)甲硅烷氧基、三(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)甲硅烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、氰基和硝基，

[0023] 其中所述C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>-环烯基、杂环基、芳基以及以下基团的芳基、杂环基和杂芳基部分可被一个或多个W<sup>a</sup>取代基取代：芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂环基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳氧基、杂芳氧基、芳基硫烷基、芳基亚磺酰基、芳基磺酰基、杂芳基硫烷基、杂芳基亚磺酰基、杂芳基磺酰基、芳基氨基、杂芳基氨基、芳氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基硫烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基亚磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳基硫烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳基亚磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳基磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基氨基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、杂芳基氨基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫烷基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基亚磺酰基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基磺酰基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫烷基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基亚磺酰基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基磺酰基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基；

[0024] • X独立地选自卤素原子、羟基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-烯基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-炔基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-卤代炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-环烷基、C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>-环烯基、甲酰基、氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基、硫烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-三烷基甲硅烷基、氰基、硝基和C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-羟基烷基，

[0025] 其中所述C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-环烷基或C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>-环烯基可被一个或多个X<sup>a</sup>取代基取代；

[0026] Z<sup>a</sup>、R<sup>3a</sup>、W<sup>a</sup>、X<sup>a</sup>和Y<sup>a</sup>独立地选自卤素原子、硝基、羟基、氰基、羧基、氨基、硫烷基、五氟-λ<sup>6</sup>-硫烷基、甲酰基、氨基甲酰基、氨基甲酸酯基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-环烷基、具有1至5个卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-卤代环烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫烷基、具有1至5个卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烷基硫烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基羰基、具有1至5个卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烷基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基甲酰基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基氨基甲酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基羰基、具有1至5个卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基羰氧基、具有1至5个卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烷基羰氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基羰基氨基、具有1至5个卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烷基羰基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫烷基、具有1至5个卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烷基硫烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基亚磺酰基、具有1至5个卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-卤代烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-

C<sub>8</sub>-烷基磺酰基和具有1至5个卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>- 卤代-烷基-磺酰基。

[0027] 如文中所用,表述“一个或多个取代基”是指取代基的数量范围为一个至基于可用的键合位点的数量计的可能取代基的最大数量,条件是满足稳定性和化学可行性的条件。

[0028] 如文中所用,卤素意指氟、氯、溴或碘;甲酰基意指-CH(=O);羧基意指-C(=O)OH;羰基意指-C(=O)-;氨基甲酰基意指-C(=O)NH<sub>2</sub>;N-羟基氨基甲酰基意指-C(=O)NHOH;SO表示亚砷基;SO<sub>2</sub>表示砷基;杂原子意指硫、氮或氧;亚甲基意指双基-CH<sub>2</sub>-;芳基意指通过从芳族烃移除一个氢原子得到的有机基团,例如苯基或萘基;除非另有说明,杂环基意指5至7元环、优选5至6元环,其可以是不饱和的、饱和的或部分饱和的,包含1至4个独立地选自N、O、S的杂原子。本文所用的术语“杂环基”涵盖杂芳基。

[0029] 本文例如在表述“5元环”或“5至6元环”中使用的术语“元”表示构成所述环的骨架原子的数量。

[0030] 如本文中所用,烷基、烯基和炔基以及含有这些术语的部分可以是直链或支链。

[0031] 当氨基或任何其他含氨基基团的氨基部分被两个可以相同或不同的取代基取代时,所述两个取代基可以与它们连接的氮原子一起形成杂环基、优选5至7元杂环基,所述杂环基可以被取代或可以包括其他杂原子,例如吗啉基或哌啶基。

[0032] 根据化合物中不对称中心的数量,本发明的任何化合物都可以以一种或多种光学异构体或手性异构体形式存在。因此,本发明同样涉及所有的光学异构体及其外消旋混合物或成比例的(scalemic)混合物(术语“成比例的”表示对映异构体的不同比例的混合物),以及涉及所有可能的立体异构体的所有比例的混合物。非对映异构体和/或光学异构体可根据本身为本领域普通技术人员所知的方法分离。

[0033] 根据化合物中双键的数量,本发明的任何化合物还可以以一种或多种几何异构体形式存在。因此,本发明同样涉及所有的几何异构体,以及所有比例的所有可能的混合物。几何异构体可根据本身为本领域普通技术人员所知的一般方法分离。

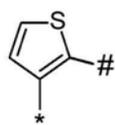
[0034] 根据链或环的取代基的相对位置(顺式/反式(syn/anti或 cis/trans)),本发明的任意化合物还可以以一种或多种几何异构体形式存在。因此,本发明同样涉及所有顺式/反式(或cis/trans)异构体,以及涉及所有比例的所有可能的顺式/反式(或cis/trans)混合物。顺式/反式(或cis/trans)异构体可以根据本身为本领域普通技术人员所知的一般方法分离。

[0035] 当本发明的化合物可以以互变异构形式存在时,本发明还涵盖这样的化合物的任意互变异构形式,即使在没有明确提及的情况下。

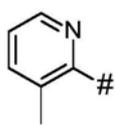
[0036] 式(I)的化合物在本文中被称为“活性成分”。

[0037] 在以上式(I)中,A可选自噻吩基、吡啶基和嘧啶基。

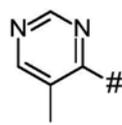
[0038] 更具体地,在以上式(I)中,A可选自A-G1、A-G2、A-G3、A-G4、A-G5、A-G6、A-G7、A-G8、A-G9、A-G10和A-G11:



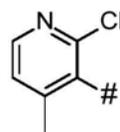
A-G1



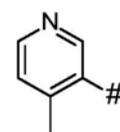
A-G2



A-G3

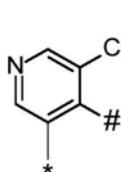


A-G4

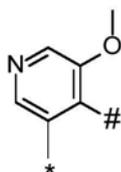


A-G5

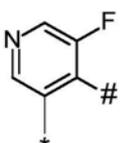
[0039]



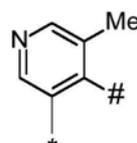
A-G6



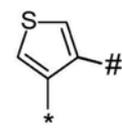
A-G7



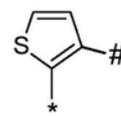
A-G8



A-G9



A-G10



A-G11

[0040] 其中“\*”表示连接至L，“#”表示连接至B。

[0041] 在一些实施方案中，在以上式(I)中，A选自A-G1、A-G2、A-G3、A-G4、A-G5、A-G6和A-G7。

[0042] 在以上式(I)中，B可选自吡咯基、噻唑基、咪唑基、二氢异噻唑基、异噻唑基、吡唑基、噻吩基、三唑基和四唑基，优选B为噻吩基或吡唑基，更优选B为吡唑基。

[0043] 在一些实施方案中，在以上式(I)中，B为部分饱和的或不饱和的5元杂环基环，其包含1、2、3或4个独立地选自N、O和S的杂原子，并且m为1、2、3或4，优选m为1。在这些实施方案中，W如本文上文中所公开，优选W选自卤素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、包含最高达9个可相同或不同的卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-羟基烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基羰基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-环烷基、芳基、芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基(其中所述芳基可被一个或多个卤素原子取代)、杂环基、羧基、三(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基)甲硅烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、杂芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基和C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基，更优选W为卤素(例如氯、溴)、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、包含最高达9个可相同或不同的卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-羟基烷基、三(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基)甲硅烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-环烷基(例如环丙基)或芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基(其中所述芳基可被一个或多个卤素原子取代)。

[0044] 在W的定义中，芳基优选意指苯基和杂环基，优选意指不饱和的、饱和的或部分饱和的5至7元环，其包含1至4个独立地选自N、O和S的杂原子。

[0045] 在一些其他实施方案中，在以上式(I)中，B为部分饱和的或不饱和的5元杂环基环，其包含氮原子和1、2或3个独立地选自N、O和S的杂原子。

[0046] 在以上式(I)中，B优选选自吡唑基、噻吩基、二氢异噻唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基和咪唑基，更优选B选自吡唑-1-基、吡唑-3-基、吡唑-4-基、吡唑-5-基、噻吩-3-基、二氢异噻唑-3-基、二氢异噻唑-5-基、噻唑-5-基、噻唑-2-基、1,2,4-三唑-5-基、咪唑-5-基和咪唑-2-基，甚至更优选B为吡唑-5-基。

[0047] 在以上式(I)中，Z优选选自氢原子、卤素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、包含最高达9个可相同或不同的卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基、包含最高达9个可相同或不同的卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-卤代烷氧基和氰基。更优选Z为氢原子、卤素原子(例如氯)、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基(例如甲基)或包含最高达9个可相同或不同的卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-卤代烷基(例如二氟甲基)，甚至更优选Z为氢原子或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基(例如甲基)。

[0048] 在上式(I)中，当存在时，X优选独立地选自卤素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-卤代烷基、羟基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基和包含最高达9个可以

相同或不同的卤素原子的  $C_1-C_6$ -卤代烷氧基;更优选X为卤素原子(例如氯、氟)、 $C_1-C_6$ -烷基(例如甲基)、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷基(例如三氟甲基)或 $C_1-C_6$ -烷氧基(例如甲氧基);甚至更优选地,当存在时,X为卤素原子(例如氯或氟)。

[0049] 在上式(I)中,n优选为0、1或2,更优选0或1。

[0050] 在上式(I)中,n优选为0、1或2,更优选0或1,X优选选自卤素原子、 $C_1-C_6$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的  $C_1-C_6$ -卤代烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基和包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷氧基;更优选X为卤素原子(例如氯、氟)、 $C_1-C_6$ -烷基(例如甲基)、 $C_1-C_6$ -卤代烷基(例如三氟甲基)或 $C_1-C_6$ -烷氧基(例如甲氧基);甚至更优选地,当存在时,X为卤素原子(例如氯或氟)。

[0051] 在上式(I)中, $Q^1$ 优选为 $CY^1$ 或N,其中 $Y^1$ 选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_3-C_7$ -环烷基、羟基、 $C_1-C_8$ -烷氧基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷氧基、 $C_1-C_8$ -烷氧基羰基、甲酰基和氰基,其中所述 $C_3-C_7$ -环烷基可被一个或多个 $Y^a$ 取代基取代,优选 $Y^1$ 选自氢、卤素(例如氯)和 $C_1-C_8$ -烷基(例如甲基)。

[0052] 在上式(I)中, $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$ 和 $Y^5$ 优选独立地选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_6$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷基、 $C_3-C_7$ -环烷基、羟基、 $C_1-C_6$ -烷氧基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷氧基、 $C_1-C_6$ -烷基羰基、甲酰基和氰基,其中所述 $C_3-C_7$ -环烷基可被一个或多个 $Y^a$ 取代基取代;更优选 $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$ 和 $Y^5$ 独立地选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_6$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷基(例如三氟甲基)和氰基;甚至更优选地, $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$ 和 $Y^5$ 独立地为氢原子或卤素原子(例如氟)。

[0053] 在上式(I)中,W优选独立地选自卤素原子、 $C_1-C_6$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷基、 $C_1-C_6$ -羟基烷基、 $C_2-C_6$ -烯基、 $C_1-C_6$ -烷氧基羰基、 $C_3-C_7$ -环烷基、芳基、芳基- $C_1-C_6$ -烷基(其中所述芳基可被一个或多个卤素原子取代)、杂环基、羧基、三( $C_1-C_6$ -烷基)甲硅烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基、杂芳基- $C_1-C_6$ -烷基和 $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基;更优选地,W为卤素(例如氯、溴)、 $C_1-C_6$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷基、 $C_1-C_6$ -羟基烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基、三( $C_1-C_6$ -烷基)甲硅烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基、 $C_3-C_7$ -环烷基(例如环丙基)或芳基- $C_1-C_6$ -烷基(其中所述芳基可被一个或多个卤素原子取代);甚至更优选地,W为 $C_1-C_6$ -烷基或  $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基。在一些实施方案中,W为 $C_1-C_6$ -烷基(例如甲基、乙基、丙基)。

[0054] 在上式(I)中,m优选为0、1、2或3,更优选0或1。

[0055] 在上式(I)中,m优选为0、1、2或3,更优选0或1,并且W独立地选自卤素原子、 $C_1-C_6$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷基、 $C_1-C_6$ -羟基烷基、 $C_2-C_6$ -烯基、 $C_1-C_6$ -烷氧基羰基、 $C_3-C_7$ -环烷基、芳基、芳基- $C_1-C_6$ -烷基(其中所述芳基可被一个或多个卤素原子取代)、杂环基、羧基、杂芳基- $C_1-C_6$ -烷基、三( $C_1-C_6$ -烷基)甲硅烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基和 $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基;更优选地,W为卤素(例如氯、溴)、 $C_1-C_6$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷基、 $C_1-C_6$ -羟基烷基、三( $C_1-C_6$ -烷基)甲硅烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基、 $C_3-C_7$ -环烷基(例如环丙基)或芳基- $C_1-C_6$ -烷基(其中所述芳基可被一个或多个卤素原子取代);更优选地,W为 $C_1-C_6$ -烷基(例如甲基、

乙基、丙基)。

[0056] 在上式(I)中,  $R^1$  优选为氢原子或卤素原子, 更优选  $R^1$  为氢原子。

[0057] 在上式(I)中,  $R^2$  优选为氢原子或卤素原子, 更优选  $R^2$  为氢原子。

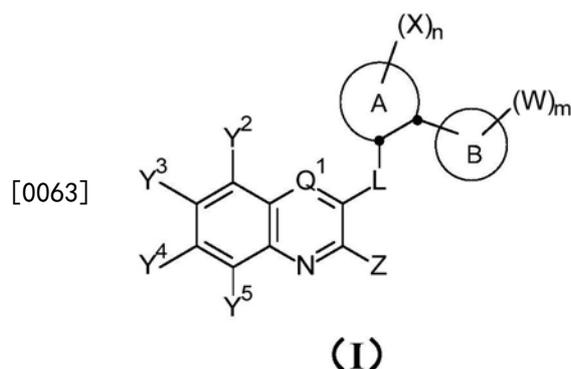
[0058] 在上式(I)中,  $R^3$  优选为氢原子或取代的或未取代的  $C_1-C_6$ -烷基, 优选  $R^3$  为氢原子或甲基, 甚至更优选  $R^3$  为氢原子。

[0059] 在一些实施方案中, 本发明的化合物为式(I)的化合物, 其中  $Y^2$  和  $Y^3$  为氢原子, 并且  $Y^4$  和  $Y^5$  为卤素原子。

[0060] 在一些实施方案中, 本发明的化合物为式(I)的化合物, 其中  $Y^2$ 、 $Y^3$  和  $Y^4$  为氢原子, 并且  $Y^5$  为卤素原子。

[0061]  $Q^1$ 、 $Y^1$ 、 $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$ 、 $Y^5$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $Z$ 、 $L$ 、 $A$ 、 $B$ 、 $X$ 、 $W$ 、 $n$  和  $m$  的上述指定定义(例如宽泛的定义以及优选的、更优选的、甚至更优选的定义)可以各种方式组合以提供本发明化合物的亚类。

[0062] 在一些实施方案(本文中称为实施方案(a))中, 本发明的化合物为式(I)的化合物:



[0064] 其中

[0065] A选自噻吩基、吡啶基和嘧啶基,

[0066] B为吡唑基或噻吩基, 优选吡唑基,

[0067]  $Q^1$  为N或  $CY^1$ , 其中  $Y^1$  选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的  $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_3-C_7$ -环烷基、羟基、 $C_1-C_8$ -烷氧基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的  $C_1-C_8$ -卤代烷氧基、 $C_1-C_8$ -烷氧基羰基、甲酰基和氰基, 其中所述  $C_3-C_7$ -环烷基可被一个或多个如本文中公开的  $Y^a$  取代基取代, 优选  $Y^1$  选自氢、卤素(例如氯)和  $C_1-C_8$ -烷基(例如甲基),

[0068]  $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$  和  $Y^5$  独立地选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_6$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的  $C_1-C_6$ -卤代烷基、 $C_3-C_7$ -环烷基、羟基、 $C_1-C_6$ -烷氧基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的  $C_1-C_6$ -卤代烷氧基、 $C_1-C_6$ -烷基羰基、甲酰基和氰基, 其中所述  $C_3-C_7$ -环烷基可被一个或多个如本文中公开的  $Y^a$  取代基取代; 优选  $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$  和  $Y^5$  独立地选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_6$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的  $C_1-C_6$ -卤代烷基(例如三氟甲基)或氰基; 更优选  $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$  和  $Y^5$  独立地为氢原子或卤素原子(例如氟),

[0069] Z选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_6$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的  $C_1-C_6$ -卤代烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的  $C_1-C_6$ -卤代烷氧基和氰基; 优选Z为氢原子、卤素原子(例如氯)、 $C_1-C_6$ -烷基(例如甲基)或包含最高达9

个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷基(例如二氟甲基);更优选Z为氢原子或 $C_1-C_6$ -烷基(例如甲基),

[0070] m为0、1、2或3,优选m为0或1,

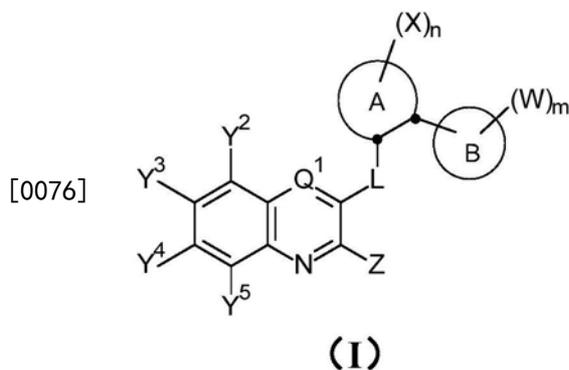
[0071] n为0、1或2,优选0或1,

[0072] L为 $CR^1R^2$ ,其中 $R^1$ 和 $R^2$ 为氢原子,或L为 $NR^3$ ,其中R为氢原子,

[0073] W独立地选自卤素原子、 $C_1-C_6$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷基、 $C_1-C_6$ -羟基烷基、 $C_2-C_6$ -烯基、 $C_1-C_6$ -烷氧基羰基、 $C_3-C_7$ -环烷基、芳基、芳基- $C_1-C_6$ -烷基(其中所述芳基可被一个或多个卤素原子取代)、杂环基、羧基、三( $C_1-C_6$ -烷基)甲硅烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基、杂芳基- $C_1-C_6$ -烷基和 $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基;优选W为卤素(例如氯、溴)、 $C_1-C_6$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷基、 $C_1-C_6$ -羟基烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基、三( $C_1-C_6$ -烷基)甲硅烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基、 $C_3-C_7$ -环烷基(例如环丙基)或芳基- $C_1-C_6$ -烷基(其中所述芳基可被一个或多个卤素原子取代);更优选W为 $C_1-C_6$ -烷基或 $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基(例如甲基、乙基、丙基);甚至更优选W为 $C_1-C_6$ -烷基;

[0074] X独立地选自卤素原子、 $C_1-C_6$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷基、羟基、 $C_1-C_6$ -烷氧基和包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷氧基;优选X为卤素原子(例如氯、氟)、 $C_1-C_6$ -烷基(例如甲基)、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷基(三氟甲基)或 $C_1-C_6$ -烷氧基(例如甲氧基);更优选X为卤素原子(例如氯)。

[0075] 在一些实施方案(本文中称为实施方案(b))中,本发明的化合物为式(I)的化合物:



[0077] 其中

[0078] A选自噻吩基、吡啶基和嘧啶基,

[0079] B为吡唑基或噻吩基,优选吡唑基,

[0080]  $Q^1$ 为N或 $CY^1$ ,其中 $Y^1$ 选自氢、卤素(例如氯)和 $C_1-C_8$ -烷基(例如甲基),

[0081]  $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$ 和 $Y^5$ 独立地为氢原子或卤素原子(例如氟),

[0082] Z为氢原子或 $C_1-C_6$ -烷基,

[0083] m为0或1,

[0084] n为0或1,

[0085] L为 $CR^1R^2$ ,其中 $R^1$ 和 $R^2$ 为氢原子,或L为 $NR^3$ ,其中 $R^3$ 为氢原子,

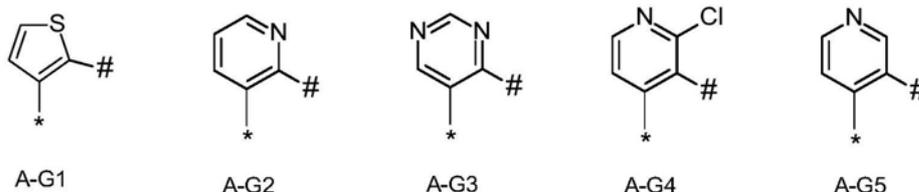
[0086] W独立地选自卤素原子、 $C_1-C_6$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的

$C_1-C_6$ -卤代烷基、 $C_1-C_6$ -羟基烷基、 $C_2-C_6$ -烯基、 $C_1-C_6$ -烷氧基羰基、 $C_3-C_7$ -环烷基、芳基、芳基- $C_1-C_6$ -烷基(其中所述芳基可被一个或多个卤素原子取代)、杂环基、羧基、三( $C_1-C_6$ -烷基)甲硅烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基、杂芳基- $C_1-C_6$ -烷基和 $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基;优选W为卤素(例如氯、溴)、 $C_1-C_6$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷基、 $C_1-C_6$ -羟基烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基、三( $C_1-C_6$ -烷基)甲硅烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基、 $C_3-C_7$ -环烷基(例如环丙基)或芳基- $C_1-C_6$ -烷基(其中所述芳基可被一个或多个卤素原子取代);更优选W为 $C_1-C_6$ -烷基或 $C_1-C_6$ -烷氧基- $C_1-C_6$ -烷基;甚至更优选W为 $C_1-C_6$ -烷基(例如甲基、乙基、丙基);

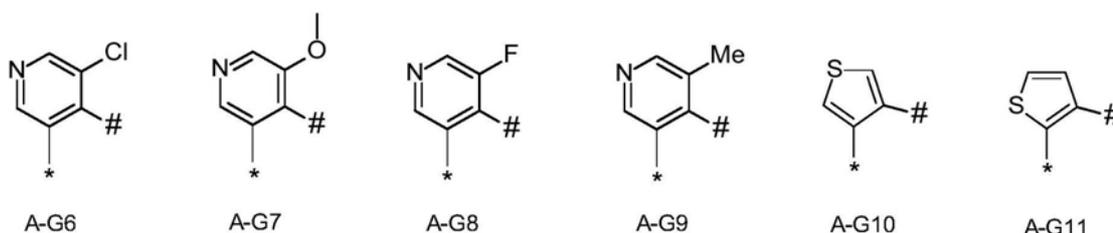
[0087] X独立地选自卤素原子、 $C_1-C_6$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷基、羟基、 $C_1-C_6$ -烷氧基和包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷氧基;优选X为卤素原子(例如氯、氟)、 $C_1-C_6$ -烷基(例如甲基)、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_6$ -卤代烷基(三氟甲基)或 $C_1-C_6$ -烷氧基(例如甲氧基);更优选X为卤素原子(例如氯)。

[0088] 在根据实施方案(a)或(b)的一些实施方案中,本发明的化合物为式(I)的化合物,其中

[0089] A选自以下基团:A-G1、A-G2、A-G3、A-G4、A-G5、A-G6、A-G7、A-G8、A-G9、A-G10和A-G11:



[0090]



[0091] 其中“\*”表示连接至L,“#”表示连接至B,优选A选自以下:A-G1、A-G2、A-G3、A-G4、A-G5、A-G6和A-G7。

[0092] 在根据实施方案(a)或(b)的一些实施方案中,本发明的化合物为式(I)的化合物,其中L为 $NR^3$ ,其中 $R^3$ 为氢原子。

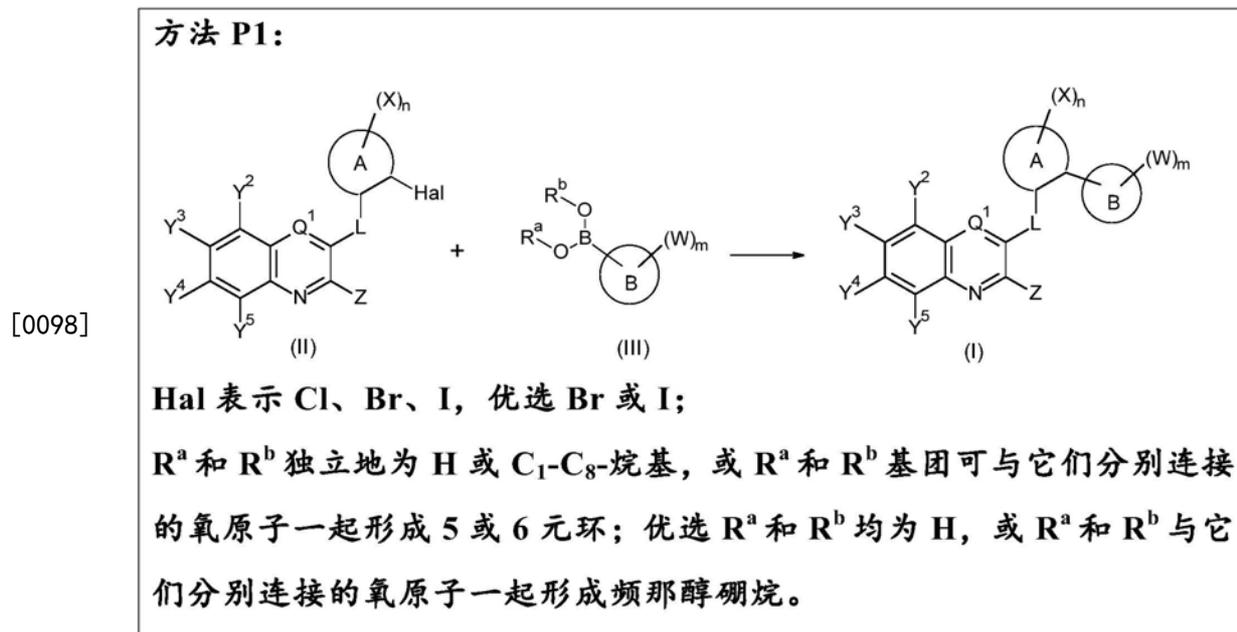
[0093] 在根据实施方案(a)或(b)的一些实施方案中,本发明的化合物为式(I)的化合物,其中 $Y^2$ 和 $Y^3$ 为氢原子,并且 $Y^4$ 和 $Y^5$ 为卤素原子。

[0094] 在根据实施方案(a)或(b)的一些实施方案中,本发明的化合物为式(I)的化合物,其中 $Y^2$ 、 $Y^3$ 和 $Y^4$ 为氢原子,并且 $Y^5$ 为卤素原子。

[0095] 活性成分的制备方法

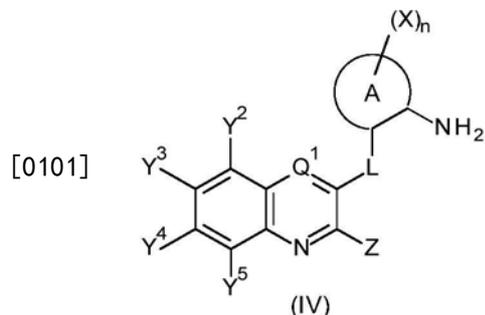
[0096] 本发明还涉及用于制备式(I)的化合物的方法。除非另有说明,基团A、B、 $Q^1$ 、 $Y^1$ 、 $Y^2$ 、 $Y^3$ 、 $Y^4$ 、 $Y^5$ 、Z、L、m、n、W和X具有上文对于式(I)的化合物给出的含义。这些定义不仅适用于式(I)的终产物,而且同样适用于所有中间体。

[0097] 如本文中定义的式(I)的化合物可通过方法P1制备,所述方法包括使式(II)的化合物与式(III)的化合物反应的步骤:



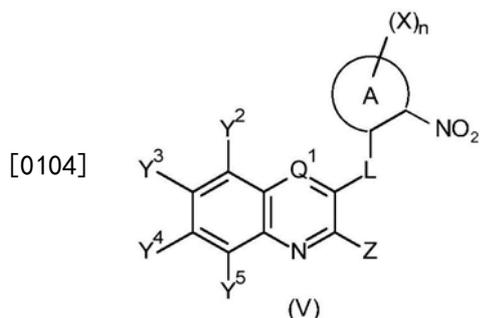
[0099] 方法P1可以根据已知方法在以下物质的存在下进行:过渡金属催化剂如钯;并且如果合适,膦配体或N-杂环碳烯配体;如果合适,碱;并且如果合适,溶剂。

[0100] 式(II)的卤代芳基衍生物可根据已知方法通过使式(IV)的苯胺或其盐之一重氮化来制备(Patai's Chemistry of Functional Groups- Amino,Nitroso,Nitro and Related Groups-1996)。



[0102] 式(II)的卤代芳基衍生物也可根据已知方法通过芳族亲核取代来制备 (Journal of Heterocyclic Chemistry (2008), 45,1199和Synthetic Communications (1999), 29, 1393)。

[0103] 式(IV)的苯胺可根据已知方法通过还原式(V)或其盐之一的硝基来制备(Patai's Chemistry of Functional Groups-Amino,Nitroso, Nitro and Related Groups-1996)。



[0105] 式(III)的硼酸或硼酸酯衍生物是市售可得的或可通过已知方法制备。

[0106] 方法P1可以在催化剂如金属盐或络合物的存在下进行。适于该目的的金属衍生物为过渡金属催化剂如钯。适于该目的的金属盐或络合物为,例如,氯化钯、乙酸钯、四(三苯基膦)钯(0)、双(二亚苄基丙酮)钯(0)、三(二亚苄基丙酮)二钯(0)、双(三苯基膦)二氯化钯(II)、[1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁]二氯化钯(II)、双(肉桂基)二氯二钯(II)、双(烯丙基)-二氯二钯(II)或[1,1'-双(二叔丁基膦基)二茂铁]二氯化钯(II)。

[0107] 还可通过单独向反应中加入钯盐以及以下配体或盐而在反应混合物中产生钯络合物:如三乙基膦、三叔丁基膦、三叔丁基四氟硼酸膦、三环己基膦、2-(二环己基膦基)联苯、2-(二叔丁基膦基)联苯、2-(二环己基膦基)-2'-(N,N-二甲基氨基)联苯、2-(叔丁基膦基)-2'-(N,N-二甲基氨基)联苯、2-二叔丁基膦基-2',4',6'-三异丙基联苯、2-二环己基膦基-2',4',6'-三异丙基联苯、2-二环己基膦基-2,6'-二甲氧基联苯、2-二环己基膦基-2',6'-二异丙氧基联苯、三苯基膦、三-(邻甲苯基)膦、3-(二苯基膦基)苯磺酸钠、三-2-(甲氧基-苯基)膦、2,2'-双(二苯基膦基)-1,1'-联萘、1,4-双(二苯基膦基)丁烷、1,2-双(二苯基膦基)乙烷、1,4-双(二环己基膦基)丁烷、1,2-双(二环己基膦基)-乙烷、2-(二环己基膦基)-2'-(N,N-二甲基氨基)-联苯、1,1'-双(二苯基膦基)-二茂铁、(R)-(-)-1-[(S)-2-二苯基-膦基]二茂铁基]乙基二环己基膦、三-(2,4-叔丁基-苯基)亚磷酸盐、二(1-金刚烷基)-2-吗啉代苯基膦或1,3-双(2,4,6-三甲基苯基)氯化咪唑鎓。

[0108] 还可有利地从商业目录如Strem Chemicals的“Metal Catalysts for Organic Synthesis”或Strem Chemicals的“Phosphorous Ligands and Compounds”中选择合适的催化剂和/或配体。

[0109] 适于进行方法P1的碱可以是通常用于这种反应的无机碱和有机碱。优选使用碱土金属氢氧化物或碱金属氢氧化物,如氢氧化钠、氢氧化钙、氢氧化钾或其他氢氧化铵衍生物;碱土金属氟化物、碱金属氟化物或氟化铵,如氟化钾、氟化铯或四丁基氟化铵;碱土金属碳酸盐或碱金属碳酸盐,如碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钾、碳酸氢钠或碳酸铯;碱金属乙酸盐或碱土金属乙酸盐,如乙酸钠、乙酸锂、乙酸钾或乙酸钙;碱金属磷酸盐或碱土金属磷酸盐,如磷酸三钾碱;碱金属醇盐,如叔丁醇钾或叔丁醇钠;叔胺,如三甲胺、三乙胺、三丁胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二环己基甲胺、N,N-二异丙基乙胺、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);以及芳族碱,如吡啶、甲基吡啶、二甲基吡啶或三甲基吡啶。

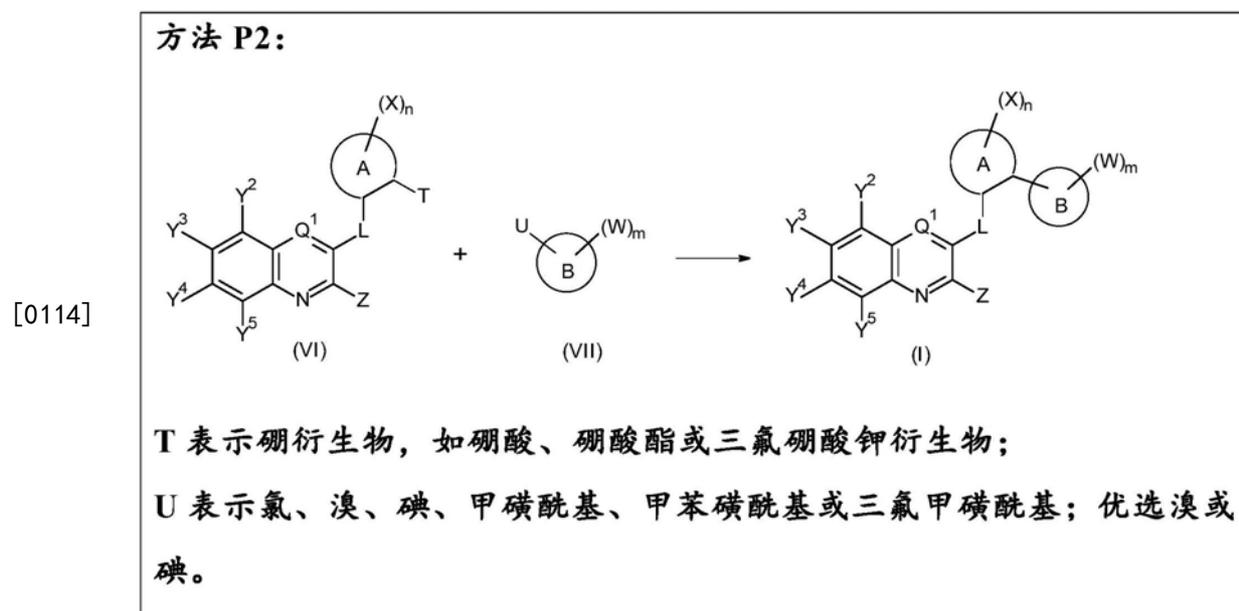
[0110] 适于进行方法P1的溶剂可以是常规的惰性有机溶剂。优选使用任选地卤代的、脂族的、脂环族的或芳族的烃类,如石油醚、戊烷、己烷、庚烷、环己烷、甲基环己烷、苯、甲苯、二甲苯或萘烷;氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷;醚类,如乙

醚、二异丙醚、甲基叔丁基醚、甲基叔戊基醚、二噁烷、四氢呋喃、2-甲基四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷或苯甲醚；腈类，如乙腈、丙腈、正丁腈或异丁腈或苯甲腈；酰胺类，如N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基甲酰苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲基磷酰三胺；脲类，如1,3-二甲基-3,4,5,6-四氢-2(1H)-嘧啶酮；酯类，如乙酸甲酯或乙酸乙酯；亚砷类，如二甲基亚砷；或砷类，如环丁砷；及其混合物。

[0111] 还可有利地使用助溶剂如水或醇如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇或叔丁醇进行方法P1。

[0112] 方法P1可以在惰性气氛如氩气或氮气气氛中进行。在进行方法P1时，每摩尔式(II)的化合物可使用1摩尔或过量的式(III)的化合物以及1至5摩尔的碱和0.01至20摩尔百分比的钨络合物。也可以使用其他比例的反应组分。通过已知方法进行后处理。

[0113] 如本文中定义的式(I)的化合物可通过方法P2制备，其包括使式(VI)的化合物与式(VII)的化合物反应的步骤：



[0115] 方法P2可以根据已知方法在以下物质的存在下进行：过渡金属催化剂如钨；并且如果合适，膦配体或N-杂环碳烯配体；如果合适，碱；并且如果合适，溶剂。

[0116] 式(VI)的硼酸或硼酸酯衍生物可以根据已知方法由卤代芳基衍生物(III)使用试剂如(频那醇合)二硼在以下物质的存在下制备：过渡金属催化剂如钨；并且如果合适，膦配体或N-杂环碳烯配体；如果合适，碱；并且如果合适，溶剂。

[0117] 适于进行方法P2和合成式(VI)的中间体的催化剂、碱和溶剂可以如关于方法P1所公开的那样。

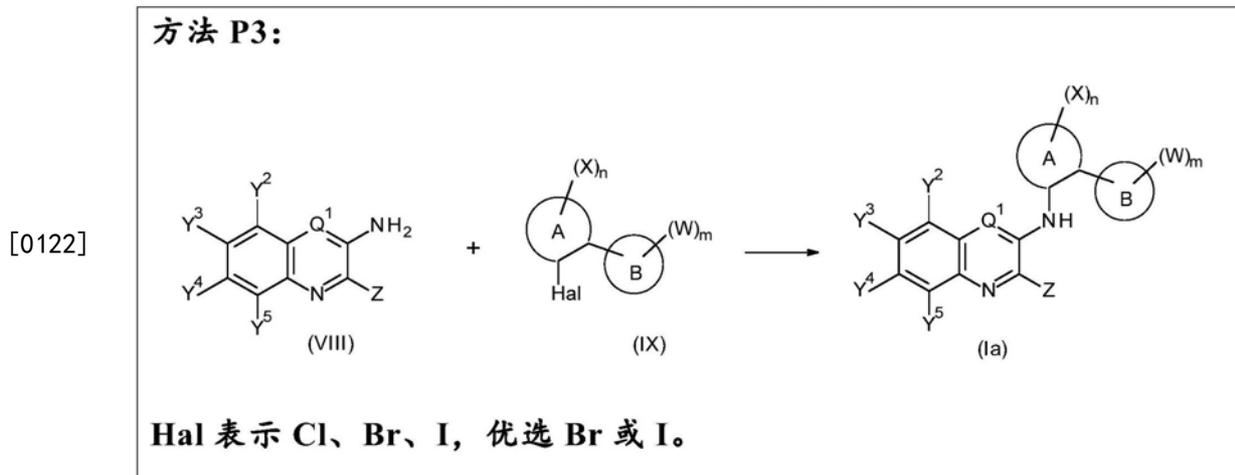
[0118] 方法P2可以在惰性气氛如氩气或氮气气氛中进行。在进行方法P2时，每摩尔式(VI)的化合物可使用1摩尔或过量的式(VII)的化合物以及1至5摩尔的碱和0.01至20摩尔百分比的钨络合物。也可以以其他比例使用反应组分。通过已知方法进行后处理。

[0119] 或者，式(VI)的硼酸或硼酸酯衍生物可以由卤代芳基衍生物(III)通过卤素金属交换，使用适当的有机金属试剂如正丁基锂和适当的硼衍生物如硼酸三甲酯在适当的有机溶剂如醚、优选四氢呋喃或乙醚中制备。

[0120] 式(VII)的卤化物衍生物是市售可得的或可通过本领域技术人员已知的方法制

备。

[0121] 如本文中定义的式 (Ia) 的化合物, 即其中 L 为 NH 的式 (I) 的化合物, 可通过方法 P3 制备, 其包括使式 (VIII) 的化合物与式 (IX) 的化合物反应的步骤:



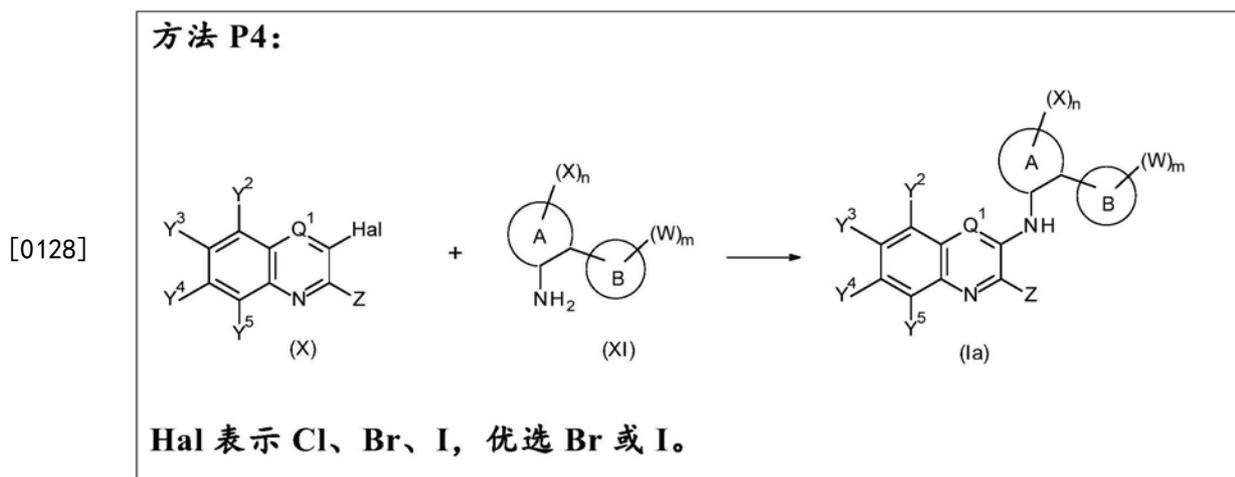
[0123] 方法 P3 可以根据已知方法在以下物质的存在下进行: 过渡金属催化剂如钯; 并且如果合适, 膦配体或 N-杂环碳烯配体; 如果合适, 碱; 并且如果合适, 溶剂。

[0124] 式 (VIII) 的胺和式 (IX) 的卤代芳基是市售可得的可或通过本领域技术人员已知的方法制备。

[0125] 适于进行方法 P3 的催化剂、碱和溶剂可以如关于方法 P1 所公开的那样。

[0126] 方法 P3 可以在惰性气氛如氩气或氮气气氛中进行。在进行方法 P3 时, 每摩尔式 (IX) 的化合物可使用 1 摩尔或过量的式 (VIII) 的化合物以及 1 至 5 摩尔的碱和 0.01 至 20 摩尔百分比的钯络合物。也可以以其他比例使用反应组分。通过已知方法进行后处理。

[0127] 或者, 如本文中定义的式 (Ia) 的化合物可以通过方法 P4 制备, 其包括使式 (X) 的化合物与式 (XI) 的化合物反应的步骤:



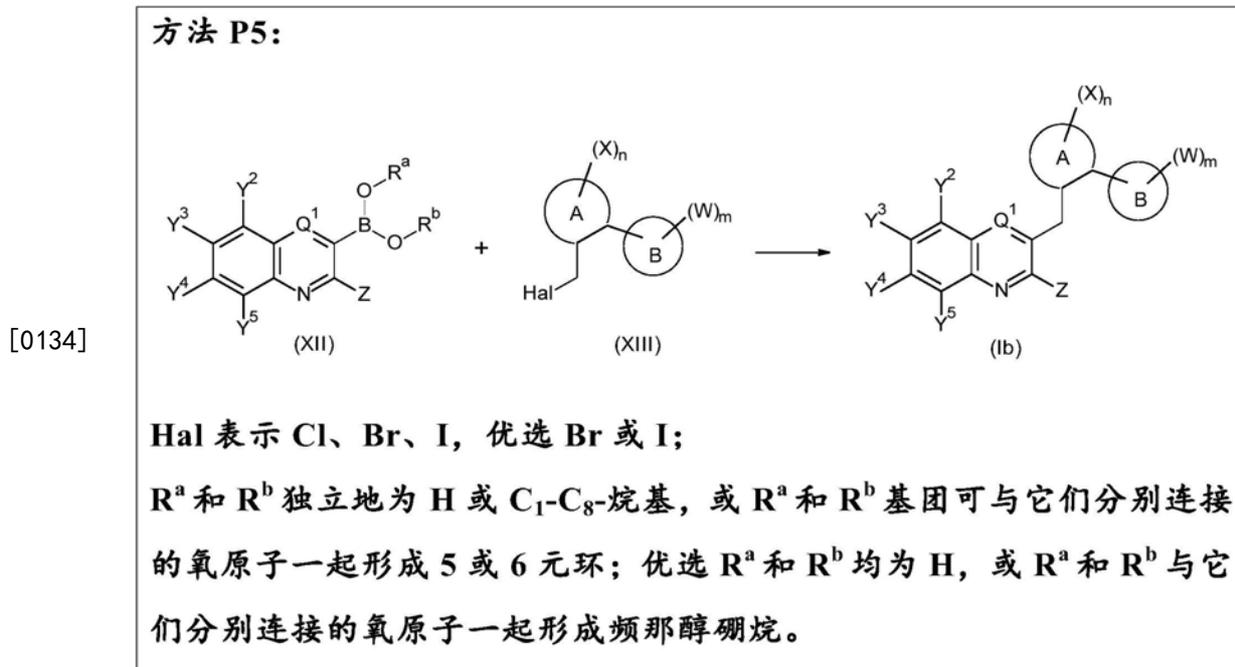
[0129] 方法 P4 可以根据已知方法在以下物质的存在下进行: 过渡金属催化剂如钯; 并且如果合适, 膦配体或 N-杂环碳烯配体; 如果合适, 碱; 并且如果合适, 溶剂。

[0130] 式 (X) 的卤代芳基和式 (XI) 的胺是市售可得的可或通过本领域技术人员已知的方法制备。

[0131] 适于进行方法 P4 的催化剂、碱和溶剂可以如关于方法 P1 所公开的那样。

[0132] 方法P4可以在惰性气氛如氩气或氮气气氛中进行。在进行方法P4时,每摩尔式(XI)的化合物可使用1摩尔或过量的式(X)的化合物以及1至5摩尔的碱和0.01至20摩尔百分比的钨络合物。也可以以其他比例使用反应组分。通过已知方法进行后处理。

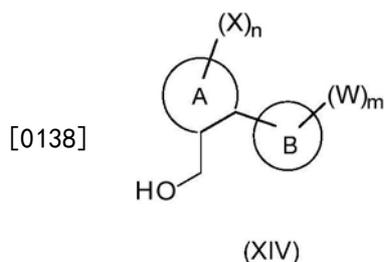
[0133] 或者,如本文中定义的式(Ib)的化合物,即其中L为CH<sub>2</sub>的式(I)的化合物,可以通过方法P5制备,其包括使式(XII)的化合物与式(XIII)的化合物反应的步骤:



[0135] 方法P5可以根据已知方法在以下物质的存在下进行:过渡金属催化剂如钨;并且如果合适,膦配体或N-杂环碳烯配体;如果合适,碱;并且如果合适,溶剂。

[0136] 式(XII)的硼衍生物是市售可得的可通过本领域技术人员已知的方法制备。

[0137] 式(XIII)的卤化物可根据已知方法通过使式(XIV)的醇卤化制备。



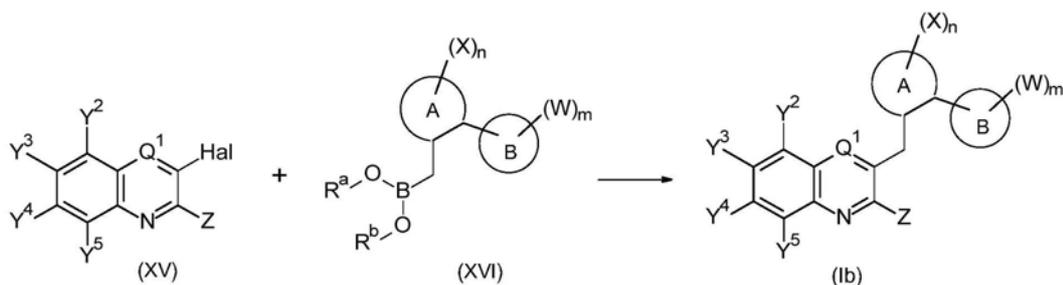
[0139] 适于进行方法P5的催化剂、碱和溶剂可以如关于方法P1所公开的那样。

[0140] 方法P5可以在惰性气氛如氩气或氮气气氛中进行。在进行方法P5时,每摩尔式(XIII)的化合物可使用1摩尔或过量的式(XII)的化合物以及1至5摩尔的碱和0.01至20摩尔百分比的钨络合物。也可以以其他比例使用反应组分。通过已知方法进行后处理。

[0141] 或者,如本文中定义的式(Ib)的化合物可以通过方法P6制备,其包括使式(XV)的化合物与式(XVI)的化合物反应的步骤:

**方法 P6:**

[0142]



**Hal** 表示 Cl、Br、I，优选 Br 或 I；

**R<sup>a</sup>** 和 **R<sup>b</sup>** 独立地为 H 或 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基，或 **R<sup>a</sup>** 和 **R<sup>b</sup>** 基团可与它们分别连接的氧原子一起形成 5 或 6 元环；优选 **R<sup>a</sup>** 和 **R<sup>b</sup>** 均为 H，或 **R<sup>a</sup>** 和 **R<sup>b</sup>** 与它们分别连接的氧原子一起形成频那醇硼烷。

[0143] 方法P6可以根据已知方法在以下物质的存在下进行：过渡金属催化剂如钯；并且如果合适，膦配体或N-杂环碳烯配体；如果合适，碱；并且如果合适，溶剂。

[0144] 式 (XV) 的卤化物和式 (XVI) 的硼衍生物是市售可得的可通过本领域技术人员已知的方法制备。

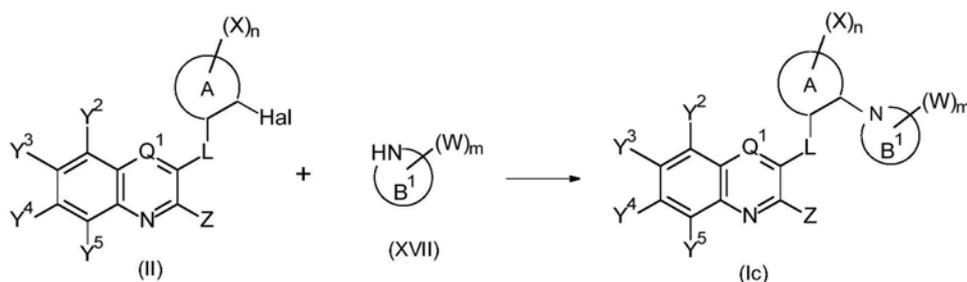
[0145] 适于进行方法P6的催化剂、碱和溶剂可以如关于方法P1所公开的那样。

[0146] 方法P6可以在惰性气氛如氩气或氮气气氛中进行。在进行方法P6 时，每摩尔式 (XVI) 的化合物可使用1摩尔或过量的式 (XV) 的化合物以及1至5摩尔的碱和0.01至20摩尔百分比的钯络合物。也可以以其他比例使用反应组分。通过已知方法进行后处理。

[0147] 如本文中定义的式 (Ic) 的化合物，即其中B为N连接的杂环，B<sup>1</sup>选自吡咯、咪唑、吡唑、1,2,3-三唑、1,2,4-三唑和四唑的式 (I) 的化合物，可以通过方法P7制备：

**方法 P7:**

[0148]



**B<sup>1</sup>** 表示以下杂环之一：吡咯、咪唑、吡唑、1,2,3-三唑、1,2,4-三唑、四唑。

[0149] 式 (Ic) 的化合物，其中杂环B<sup>1</sup>通过其氮原子连接至苯环，可通过使式 (II) 的卤化物与式 (XVII) 的杂环反应来制备。该反应可以在催化剂如碘化亚铜的存在下进行，也可以使用配体如二胺、氨基醇、氨基酸或膦。该反应通常在碱如磷酸钾、碳酸钾或碳酸钠的存在

下进行。至于溶剂,可使用极性非质子溶剂如N,N-二甲基甲酰胺或二甲基亚砷。

[0150] 式(II)的中间体可由式(IV)的苯胺制备(方法1)。式(XVII)的杂环是市售可得的或可通过本领域技术人员已知的方法制备。

[0151] 用于该目的的其他合适的铜盐或络合物及其水合物为例如,金属铜、碘化亚铜(I)、氯化亚铜(I)、溴化亚铜(I)、氯化铜(II)、溴化铜(II)、氧化铜(II)、氧化亚铜(I)、乙酸铜(II)、乙酸亚铜(I)、噻吩-2-羧酸铜(I)、氰化亚铜(I)、硫酸铜(II)、双(2,2,6,6-四甲基-3,5-庚二酸)铜、三氟甲烷磺酸铜(II)、四(乙腈)六氟磷酸铜(I)、四(乙腈)四氟硼酸铜(I)。

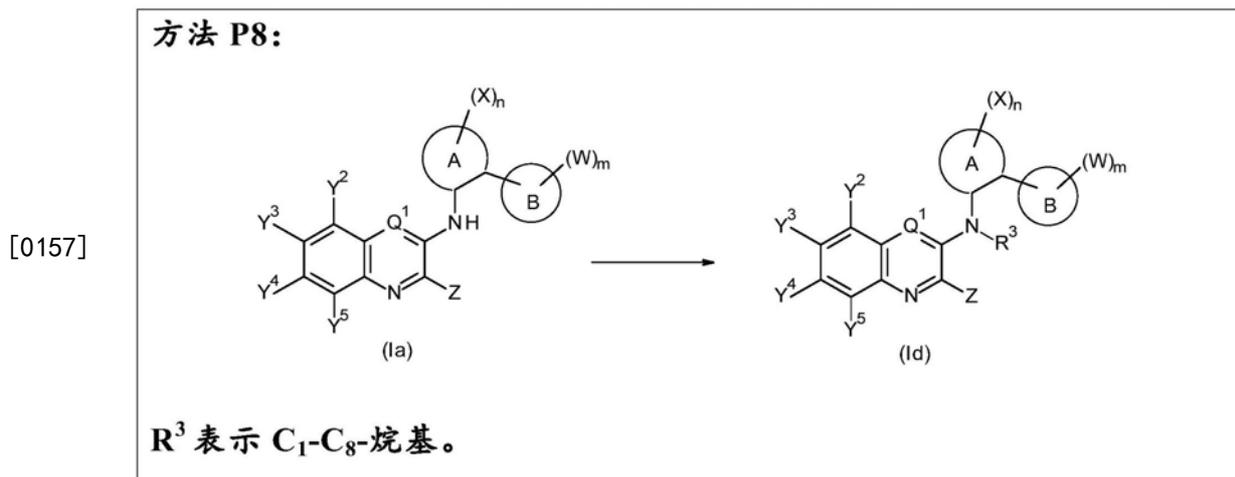
[0152] 还可通过单独向反应中加入铜盐以及以下配体或盐而在反应混合物中生成铜络合物:如乙二胺、N,N-二甲基乙二胺、N,N'-二甲基乙二胺、外消旋-反式-1,2-二氨基环己烷、外消旋-反式-N,N'-二甲基环己烷-1,2-二胺、1,1'-联萘-2,2'-二胺、N,N,N',N'-四甲基乙二胺、脯氨酸、N,N'-二甲基甘氨酸、喹啉-8-醇、吡啶、2-氨基吡啶、4-(二甲基氨基)吡啶、2,2'-联吡啶、2,6-二(2-吡啶基)吡啶、2-吡啶甲酸、2-(二甲基氨基甲基)-3-羟基吡啶、1,10-菲咯啉、3,4,7,8-四甲基-1,10-菲咯啉、2,9-二甲基-1,10-菲咯啉、4,7-二甲氧基-1,10-菲咯啉、N,N'-双[(E)-吡啶-2-基亚甲基]环己烷-1,2-二胺、N-[(E)-苯基亚甲基]、N-[(E)-苯基亚甲基]-环己胺、1,1,1-三(羟甲基)乙烷、乙二醇、2,2,6,6-四甲基庚烷-3,5-二酮、2-(2,2-二甲基丙酰基)环己酮、乙酰丙酮、二苯甲酰基甲烷、2-(2-甲基丙酰基)环己酮、联苯-2-基(二叔丁基)膦、亚乙基双-(二苯基膦)、N,N-二乙基水杨酰胺、2-羟基苯甲醛肟、氧代[(2,4,6-三甲基苯基)氨基]乙酸或1H-吡咯-2-甲酸。

[0153] 还可有利地从商业目录如Strem Chemicals的“Metal Catalysts for Organic Synthesis”或综述(Chemical Society Reviews(2014),43,3525, Coordination Chemistry Reviews(2004),248,2337及其中的参考文献)中选择合适的催化剂和/或配体。

[0154] 用于进行方法P7的其他合适的碱和溶剂可以如关于方法P1所公开的那样。

[0155] 方法P7可以在惰性气氛如氩气或氮气气氛中进行。在进行方法P7时,每摩尔式(II)的化合物可使用1摩尔或过量的式(XVII)的化合物以及1至5摩尔的碱和0.01至20摩尔百分比的铜盐和0.01至1摩尔百分比的铜配体。也可以以其他比例使用反应组分。通过已知方法进行后处理。

[0156] 可根据方法P8将式(Ia)的化合物用于制备化合物(Id)(即式I的化合物,其中L为NR<sup>3</sup>,其中R<sup>3</sup>为C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基):



[0158] 根据方法P1、P2、P3、P4或P7制备的式(Ia)的化合物可用于制备式(Id)的化合物。通常,用碱如氢氧化钠和烷基卤化物、优选碘代烷基如碘代甲烷处理式(Ia)的化合物。反应通常在极性非质子溶剂如二甲基甲酰胺中进行。

[0159] 在进行方法P8时,每摩尔烷基卤化物可使用1摩尔或过量的式(Ia)的化合物以及1至5摩尔的碱。也可以以其他比例使用所述反应组分。通过已知方法进行后处理。

[0160] 方法P1、P2、P3、P4、P5、P6、P7和P8通常在大气压力下进行。也可在高压或低压下操作。

[0161] 在进行方法P1、P2、P3、P4、P5、P6、P7和P8时,反应温度可在相对宽的范围内变化。通常,这些方法在-78℃至200℃、优选-78℃至150℃的温度下进行。控制所述方法温度的方法是使用微波技术。

[0162] 通常,将反应混合物在降低的压力下浓缩。可通过已知方法如色谱法或结晶法从剩余的残余物中除去仍然可能存在的任何杂质。

[0163] 通过常规方法进行后处理。通常,反应混合物用水处理,分离出有机相,并且在干燥后在减压下浓缩。如果合适,可通过常规方法如色谱法、结晶法或蒸馏法从剩余的残余物中除去仍然可能存在的任何杂质。

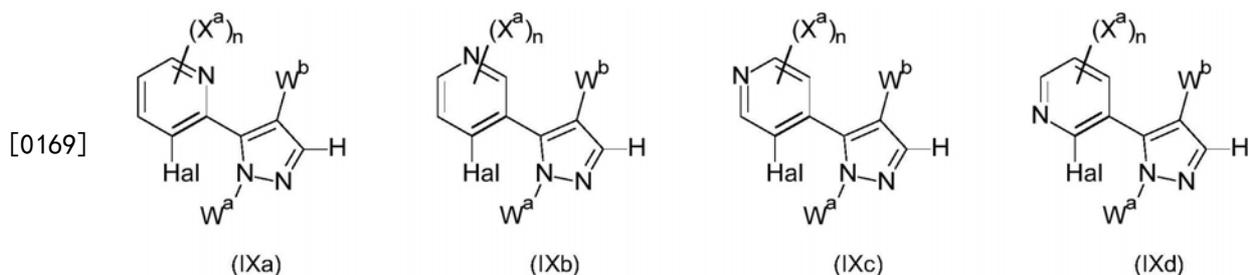
[0164] 式(I)的化合物可根据上述一般制备方法制备。然而,应当理解,基于其常识和可获得的出版物,技术人员将能够根据期望合成的每种化合物的具体情况来调整所述方法。

[0165] 用于制备活性成分的中间体

[0166] 本发明还涉及用于制备式(I)的化合物的中间体。

[0167] 如上所述,基团A、B、Q1、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>、Y<sup>3</sup>、Y<sup>4</sup>、Y<sup>5</sup>、Z、L、m、n、W和X具有上文中对于式(I)的化合物给出的含义。

[0168] 根据本发明的中间体为式(IXa)、(IXb)、(IXc)或(IXd)的化合物及其可接受的盐:



[0170] 其中：

[0171] Hal表示氯、溴或碘；

[0172]  $X^a$ 选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基和 $C_3-C_7$ -环烷基；

[0173]  $W^a$ 选自 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_1-C_8$ -烷基和 $C_3-C_7$ -环烷基；和

[0174]  $W^b$ 选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基和 $C_3-C_7$ -环烷基，

[0175] 条件是式 (IXd) 的化合物不表示：

[0176] -3-碘-4-甲基-2-(1-甲基-1H-吡唑-5-基)吡啶 [2246369-43-5]，和

[0177] -5-溴-3-氯-2-(1-甲基-1H-吡唑-5-基)吡啶 [1159186-44-3]。

[0178] 在化学数据库和/或供应商的数据库中提及了以下化合物，但没有任何使得能够制备和分离这些化合物的参考资料或信息：

[0179] 式 (IXb) 的化合物：

[0180] -3-溴-4-(1-甲基-1H-吡唑-5-基)吡啶 [1781447-30-0]；

[0181] 式 (IXd) 的化合物：

[0182] 3,6-二氯-2-(1-甲基-1H-吡唑-5-基)吡啶 [2090578-74-6]，

[0183] 2,3,5-三氯-6-(1-丙基-1H-吡唑-5-基)吡啶 [1972534-13-6]，

[0184] 3-溴-2-(1-甲基-1H-吡唑-5-基)吡啶 [1783689-74-6]，

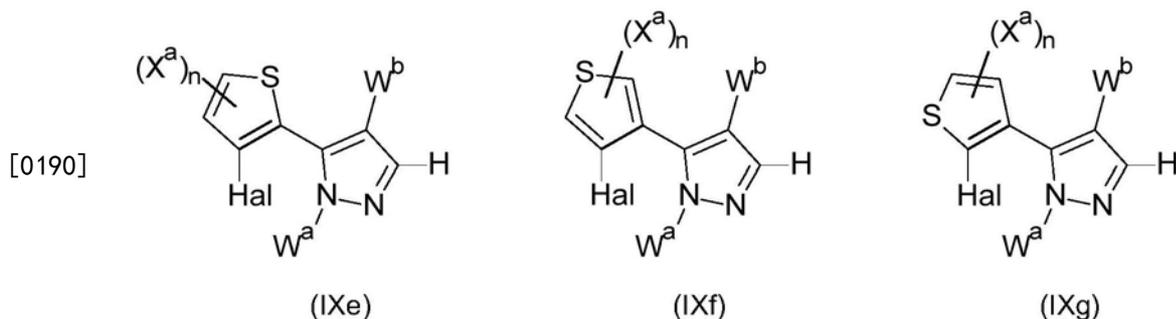
[0185] 2,3,5-三氯-6-(1-乙基-1H-吡唑-5-基)吡啶 [1602953-57-0]，和

[0186] 2,3,5-三氯-6-(1-甲基-1H-吡唑-5-基)吡啶 [1598118-86-5]。

[0187] 优选的式 (IXa) 的化合物为3-溴-2-(1-甲基-1H-吡唑-5-基)吡啶。

[0188] 优选的式 (IXc) 的化合物为3-氯-4-(1-乙基-1H-吡唑-5-基)吡啶。

[0189] 根据本发明的其他中间体为式 (IXe)、(IXf) 或 (IXg) 的化合物及其可接受的盐：



[0191] 其中：

[0192] Hal表示氯、溴或碘；

[0193]  $X^a$ 选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基和 $C_3-C_7$ -环烷基；

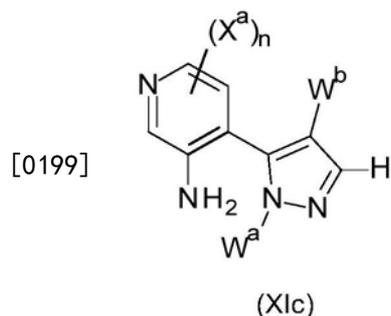
[0194]  $W^a$ 选自 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_1-C_8$ -烷基和 $C_3-C_7$ -环烷基；和

[0195]  $W^b$ 选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基和 $C_3-C_7$ -环烷基，

[0196] 条件是式 (IXf) 的化合物不表示5-(2,5-二氯-3-噻吩基)-1-异丙基-1H-吡唑 [1416731-87-7]。

[0197] 优选的式 (IXe) 的化合物为5-(3-溴-2-噻吩基)-1-甲基-1H-吡唑和5-(3-溴-2-噻吩基)-1-乙基-1H-吡唑。

[0198] 根据本发明的其他中间体为式 (XIc) 的化合物及其可接受的盐：



[0200] 其中：

[0201]  $X^a$ 选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基和 $C_3-C_7$ -环烷基；

[0202]  $W^a$ 选自 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_1-C_8$ -烷基和 $C_3-C_7$ -环烷基；和

[0203]  $W^b$ 选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基和 $C_3-C_7$ -环烷基，

[0204] 条件是式 (XIc) 的化合物不表示4-(1-甲基-1H-吡唑-5-基)吡啶-3-胺 [1555428-90-4]。

[0205] 在化学数据库和/或供应商的数据库中提及了以下式 (XIc) 的化合物，但没有任何使得能够制备和分离这些化合物的参考资料或信息：

[0206] -4-(4-氟-1-甲基-1H-吡唑-5-基)吡啶-3-胺 [2303819-45-4]，

[0207] -4-(4-乙基-1-甲基-1H-吡唑-5-基)吡啶-3-胺 [2303806-07-5]，

[0208] -4-(1-叔丁基-1H-吡唑-5-基)吡啶-3-胺 [2300416-73-1]，

[0209] -4-(1-环丙基-1H-吡唑-5-基)吡啶-3-胺 [2296251-87-9]，

[0210] -4-(1-环丁基-1H-吡唑-5-基)吡啶-3-胺 [2286051-07-6]，

[0211] -4-[1-(环丙基甲基)-1H-吡唑-5-基]吡啶-3-胺 [2149171-85-5]，

[0212] -4-(1-异丁基-1H-吡唑-5-基)吡啶-3-胺 [2142803-96-9]，

[0213] -4-[1-(2-甲氧基乙基)-1H-吡唑-5-基]吡啶-3-胺 [1878851-79-6]，

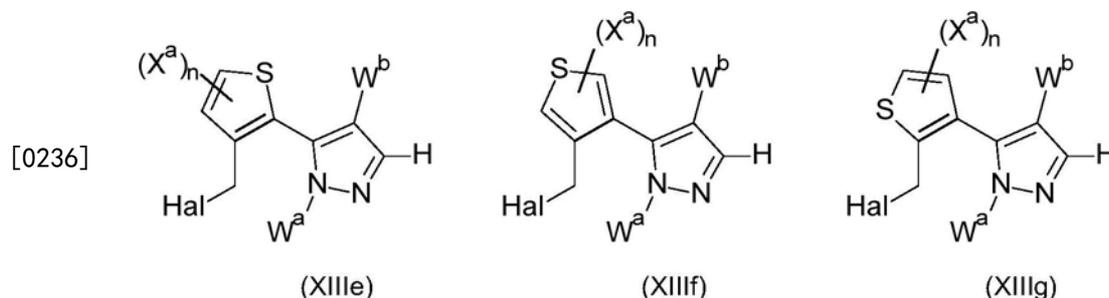
[0214] -4-(1,4-二甲基-1H-吡唑-5-基)吡啶-3-胺 [1862706-70-4]，

[0215] -4-(1-异丙基-1H-吡唑-5-基)吡啶-3-胺 [1696182-41-8]，



[0234]  $W^b$ 选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基和 $C_3-C_7$ -环烷基。

[0235] 根据本发明的其他中间体为式 (XIIIe)、(XIII f) 或 (XIII g) 的化合物及其可接受的盐:



[0237] 其中:

[0238] Hal表示氯、溴或碘;

[0239]  $X^a$ 选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基和 $C_3-C_7$ -环烷基;

[0240]  $W^a$ 选自 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基- $C_1-C_8$ -烷基和 $C_3-C_7$ -环烷基;和

[0241]  $W^b$ 选自氢原子、卤素原子、 $C_1-C_8$ -烷基、包含最高达9个可以相同或不同的卤素原子的 $C_1-C_8$ -卤代烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基和 $C_3-C_7$ -环烷基。

[0242] 组合物和制剂

[0243] 本发明还涉及一种组合物、特别是用于防治不想要的微生物的组合物。所述组合物可施用至微生物和/或其生境。

[0244] 所述组合物通常包含至少一种式 (I) 的化合物和至少一种农业上合适的助剂,例如载体和/或表面活性剂。

[0245] 载体是通常为惰性的固体或液体、天然的或合成的、有机的或无机的物质。载体通常改善化合物对例如植物、植物部位或种子的施用。合适的固体载体的实例包括但不限于:铵盐,天然岩粉如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、绿坡缕石、蒙脱土和硅藻土,以及合成岩粉如细碎的二氧化硅、氧化铝和硅酸盐。用于制备颗粒的通常有用的固体载体的实例包括但不限于:粉碎并分级的天然岩石如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石,无机和有机粉末的合成颗粒,以及有机材料如纸、锯屑、椰壳、玉米穗轴和烟草茎的颗粒。合适的液体载体的实例包括但不限于:水、有机溶剂及其组合。合适的溶剂的实例包括极性和非极性有机化学液体,例如来自芳族和非芳族烃类(如环己烷、链烷烃、烷基苯、二甲苯、甲苯烷基萘、氯代芳族或氯代脂族烃,如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷),醇类和多元醇类(其可任选地被取代、醚化和/或酯化,如丁醇或乙二醇),酮类(如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮),酯类(包括脂肪和油)和(聚)醚,未取代和取代的胺,酰胺(如二甲基甲酰胺),内酰胺(如N-烷基吡咯烷酮)和内酯,砷和亚砷(如二甲基亚砷)。载体还可为液化的气态增量剂,即在标准温度和标准压力下为气态的液体,例如气溶胶喷射剂如卤代烃类、丁烷、丙烷、氮气和二氧化碳。载体的量通常为组合物的1至99.99重量%、优选5至99.9重量%、更优选10至99.5重量%且最优选20至99重量%。

[0246] 表面活性剂可以是离子(阳离子或阴离子)或非离子表面活性剂,如离子或非离子乳化剂、发泡剂、分散剂、润湿剂及其任意混合物。合适的表面活性剂的实例包括但不限于:聚丙烯酸盐、木素磺酸盐、苯酚磺酸盐或萘磺酸盐、环氧乙烷和/或环氧丙烷与脂肪醇、脂肪酸或脂肪胺的缩聚物(聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚,例如烷基芳基聚乙二醇醚)、取代的酚(优选烷基酚或芳基酚)、磺基琥珀酸盐的盐、牛磺酸衍生物(优选烷基牛磺酸盐)、聚乙氧基化的醇类或酚类的磷酸酯、多元醇的脂肪酸酯,以及含有硫酸盐、磺酸盐和磷酸盐的化合物的衍生物(例如烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐)和蛋白质水解产物、木素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。当式(I)的化合物和/或载体不溶于水并且施用用水进行时,通常使用表面活性剂。其次,表面活性的量通常为组合物的5至40重量%。

[0247] 合适的助剂的其他实例包括:防水剂、干燥剂、粘合剂(胶粘剂、增粘剂、固定剂如羧甲基纤维素,粉末、颗粒或胶乳形式的天然聚合物和合成的聚合物,如阿拉伯胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯,天然磷脂例如脑磷脂和卵磷脂以及合成磷脂、聚乙烯吡咯烷酮和甲基纤维素(tylose))、增稠剂、稳定剂(例如冷稳定剂、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂或其它改善化学和/或物理稳定性的试剂)、染料或颜料(如无机颜料,例如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝;有机染料,例如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料)、消泡剂(例如硅酮消泡剂和硬脂酸镁)、防腐剂(例如双氯酚和苜醇半缩甲醛)、二次增稠剂(纤维素衍生物、丙烯酸衍生物、黄原胶、改性粘土以及细碎的二氧化硅)、粘着剂、赤霉素和加工助剂、矿物油和植物油、香料、蜡、营养素(包括微量营养素,如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐)、保护胶体、触变性物质、渗透剂、螯合剂和络合形成剂。

[0248] 助剂的选择与式(I)的化合物的预期施用方式和/或其物理性质有关。此外,可选择助剂以赋予组合物或其制备的使用形式特定的性质(技术的、物理的和/或生物学性质)。助剂的选择可允许根据具体需要定制组合物。

[0249] 组合物可以为任意常规形式,如溶液剂(例如水溶液)、乳剂、可湿性粉剂、水基和油基悬浮液、粉剂、尘剂、糊剂、可溶性粉剂、可溶性颗粒剂、用于撒播的颗粒剂、悬乳浓缩剂、用式(I)化合物浸渍的天然或合成产物、肥料以及聚合物物质中的微胶囊剂。式(I)的化合物可以以悬浮的、乳化的或溶解的形式存在。

[0250] 可将组合物以即用型制剂的形式提供给最终用户,即可以通过合适的装置如喷雾装置或撒粉装置直接将组合物施用至植物或种子。或者,可将组合物以浓缩物的形式提供给最终用户,所述浓缩物在使用前必须进行稀释、优选用水稀释。

[0251] 所述组合物可以以常规方式制备,例如通过将式(I)的化合物与一种或多种如本文上文中所公开的合适的助剂混合。

[0252] 组合物通常含有0.01至99重量%、0.05至98重量%、优选0.1至95重量%、更优选0.5至90重量%、最优选1至80重量%的式(I)的化合物。组合物可能包含两种或更多种式(I)的化合物。在这种情况下,所述范围是指本发明化合物的总量。

#### [0253] 混合物/结合物

[0254] 可将式(I)的化合物和包含其的组合物与其他活性成分如杀真菌剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀昆虫剂、除草剂、肥料、生长调节剂、安全剂或化学信息素混合。这可以拓宽活性谱或防止抗性发展。已知杀真菌剂、杀昆虫剂、杀螨剂、杀线虫剂和杀细菌剂的实例公开于 Pesticide Manual,第17版中。

[0255] 可与式(I)的化合物和所述组合物混合的特别优选的杀真菌剂的实例为:

[0256] 1) 麦角固醇生物合成抑制剂,例如(1.001)环丙唑醇(cyproconazole)、(1.002)苯醚甲环唑(difenoconazole)、(1.003)氟环唑(epoxiconazole)、(1.004)环酰菌胺(fenhexamid)、(1.005)苯锈啶(fenpropidin)、(1.006)丁苯吗啉(fenpropimorph)、(1.007)胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)、(1.008)氟喹唑(flutriazole)、(1.009)粉唑醇(flutriafol)、(1.010)抑霉唑(imazalil)、(1.011)抑霉唑硫酸盐(imazalil sulfate)、(1.012)种菌唑(ipconazole)、(1.013)叶菌唑(metconazole)、(1.014)腈菌唑(myclobutanil)、(1.015)多效唑(paclobutrazol)、(1.016)咪鲜胺(prochloraz)、(1.017)丙环唑(propiconazole)、(1.018)丙硫菌唑(prothioconazole)、(1.019)啉菌唑(Pyrisoxazole)、(1.020)螺环菌胺(spiroxamine)、(1.021)戊唑醇(tebuconazole)、(1.022)四氟醚唑(tetraconazole)、(1.023)三唑醇(triadimenol)、(1.024)十三吗啉(tridemorph)、(1.025)灭菌唑(triticonazole)、(1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇、(1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇、(1.028) (2R)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.029) (2R)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.030) (2R)-2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.031) (2S)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.032) (2S)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.033) (2S)-2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.034) (R)-[3-(4-氯-2-氟苄基)-5-(2,4-二氟苄基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.035) (S)-[3-(4-氯-2-氟苄基)-5-(2,4-二氟苄基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.036) [3-(4-氯-2-氟苄基)-5-(2,4-二氟苄基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.037) 1-({(2R,4S)-2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-4-甲基-1,3-二氧戊环-2-基}甲基)-1H-1,2,4-三唑、(1.038) 1-({(2S,4S)-2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-4-甲基-1,3-二氧戊环-2-基}甲基)-1H-1,2,4-三唑、(1.039) 1-[[3-(2-氯苄基)-2-(2,4-二氟苄基)环氧乙烷-2-基]甲基]-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.040) 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-氯苄基)-2-(2,4-二氟苄基)环氧乙烷-2-基]甲基]-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.041) 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-氯苄基)-2-(2,4-二氟苄基)环氧乙烷-2-基]甲基]-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-二氯苄基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-二氯苄基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-二氯苄基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-二氯苄基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-二氯苄基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-二氯苄基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-二氯苄基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-二氯苄基)-5-羟基-2,6,

6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.050) 2-[1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.051) 2-[2-氯-4-(2,4-二氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.052) 2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.053) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.054) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)戊-2-醇、(1.055) 氯氟醚菌唑 (Mefentrifluconazole)、(1.056) 2-[[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.057) 2-[[rel (2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.058) 2-[[rel (2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.059) 5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇、(1.060) 5-(烯丙基硫烷基)-1-[[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基]-1H-1,2,4-三唑、(1.061) 5-(烯丙基硫烷基)-1-[[rel (2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基]-1H-1,2,4-三唑、(1.062) 5-(烯丙基硫烷基)-1-[[rel (2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基]-1H-1,2,4-三唑、(1.063) N'-(2,5-二甲基-4-[[3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]硫烷基]苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.064) N'-(2,5-二甲基-4-[[3-(2,2,2-三氟乙氧基)苯基]硫烷基]苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.065) N'-(2,5-二甲基-4-[[3-(2,2,3,3-四氟丙氧基)苯基]硫烷基]苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.066) N'-(2,5-二甲基-4-[[3-(五氟乙氧基)苯基]硫烷基]苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.067) N'-(2,5-二甲基-4-[[3-[(1,1,2,2-四氟乙基)硫烷基]苯氧基]苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.068) N'-(2,5-二甲基-4-[[3-[(2,2,2-三氟乙基)硫烷基]苯氧基]苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.069) N'-(2,5-二甲基-4-[[3-[(2,2,3,3-四氟丙基)硫烷基]苯氧基]苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.070) N'-(2,5-二甲基-4-[[3-[(五氟乙基)硫烷基]苯氧基]苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.071) N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.072) N'-(4-[[3-(二氟甲氧基)苯基]硫烷基]-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.073) N'-(4-[[3-[(二氟甲基)硫烷基]苯氧基]-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.074) N'-[5-溴-6-(2,3-二氢-1H-茛-2-基氧基)-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.075) N'-[4-[(4,5-二氯-1,3-噻唑-2-基)氧基]-2,5-二甲基苯基]-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.076) N'-[5-溴-6-[(1R)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.077) N'-[5-溴-6-[(1S)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.078) N'-[5-溴-6-[(顺式-4-异丙基环己基)氧基]-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.079) N'-[5-溴-6-[(反式-4-异丙基环己基)氧基]-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.080) N'-[5-溴-6-[1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基酰亚氨基甲酰胺、(1.081) Ipfentrifluconazole。

[0257] 2) 呼吸链复合物I或II抑制剂,例如(2.001) 苯并烯氟菌唑 (benzovindiflupyr)、(2.002) 联苯吡菌胺 (bixafen)、(2.003) 啶酰菌胺 (boscalid)、(2.004) 萎锈灵 (carboxin)、

(2.005) 氟吡菌酰胺 (fluopyram)、(2.006) 氟酰胺 (flutolanil)、(2.007) 氟唑菌酰胺 (fluxapyroxad)、(2.008) 呋吡菌胺 (furametpyr)、(2.009) 异丙噻菌胺 (Isopetamid)、(2.010) 吡唑萘菌胺 (isopyrazam) (反式差向异构对映体1R,4S,9S)、(2.011) 吡唑萘菌胺 (反式差向异构对映体1S,4R,9R)、(2.012) 吡唑萘菌胺 (反式差向异构外消旋体 1RS,4SR,9SR)、(2.013) 吡唑萘菌胺 (顺式差向异构外消旋体 1RS,4SR,9RS与反式差向异构外消旋体 1RS,4SR,9SR的混合物)、(2.014) 吡唑萘菌胺 (顺式差向异构对映体1R,4S,9R)、(2.015) 吡唑萘菌胺 (顺式差向异构对映体1S,4R,9S)、(2.016) 吡唑萘菌胺 (顺式差向异构外消旋体 1RS,4SR,9RS)、(2.017) 戊苯吡菌胺 (penflufen)、(2.018) 吡噻菌胺 (penthioopyrad)、(2.019) 氟唑菌酰胺 (pydiflumetofen)、(2.020) Pyraziflumid、(2.021) 氟唑环菌胺 (sedaxane)、(2.022) 1,3-二甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.023) 1,3-二甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.024) 1,3-二甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.025) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[2'-(三氟甲基)联苯-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.026) 2-氟-6-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)苯甲酰胺、(2.027) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.028) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.029) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.030) Fluindapyr、(2.031) 3-(二氟甲基)-N-[(3R)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.032) 3-(二氟甲基)-N-[(3S)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.033) 5,8-二氟-N-[2-(2-氟-4-{[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]氧基}苯基)乙基]喹唑啉-4-胺、(2.034) N-(2-环戊基-5-氟苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.035) N-(2-叔丁基-5-甲基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.036) N-(2-叔丁基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.037) N-(5-氯-2-乙基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.038) isoflucypram、(2.039) N-[(1R,4S)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-桥亚甲基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.040) N-[(1S,4R)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-桥亚甲基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.041) N-[1-(2,4-二氯苯基)-1-甲氧基丙-2-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.042) N-[2-氯-6-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.043) N-[3-氯-2-氟-6-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.044) N-[5-氯-2-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.045) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-N-[5-甲基-2-(三氟甲基)苄基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.046) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-氟-6-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.047) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基-5-甲基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.048) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.049) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.050) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(5-氟-2-异丙基苄基)-1-甲

基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.051)N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-4,5-二甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.052)N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-氟苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.053)N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.054)N-环丙基-N-(2-环丙基-5-氟苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.055)N-环丙基-N-(2-环丙基-5-甲基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.056)N-环丙基-N-(2-环丙基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.057) pyrapropoyne。

[0258] 3)呼吸链复合物III抑制剂,例如(3.001)唑啉菌胺(ametocetradin)、(3.002)安美速(amisulbrom)、(3.003)噻菌酯(azoxystrobin)、(3.004)甲香菌酯(coumethoxystrobin)、(3.005)丁香菌酯(coumoxystrobin)、(3.006)氰霜唑(cyazofamid)、(3.007)醚菌胺(dimoxystrobin)、(3.008)烯肟菌酯(enoxastrobin)、(3.009)恶唑菌酮(famoxadone)、(3.010)咪唑菌酮(fenamidone)、(3.011)氟菌螨酯(flufenoxystrobin)、(3.012)氟啉菌酯(fluxastrobin)、(3.013)醚菌酯(kresoxim-methyl)、(3.014)苯氧菌胺(metominostrobin)、(3.015)肟醚菌胺(orysastrobin)、(3.016)啉氧菌酯(picoxystrobin)、(3.017)唑菌胺酯(pyraclostrobin)、(3.018)唑胺菌酯(pyrametostrobin)、(3.019)唑菌酯(pyraoxystrobin)、(3.020)肟菌酯(trifloxystrobin)、(3.021) (2E)-2-{2-[[{(1E)-1-(3-{[(E)-1-氟-2-苯基乙烯基]氧基}苯基)亚乙基]氨基}氧基]甲基]苯基}-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、(3.022) (2E,3Z)-5-{[1-(4-氯苯基)-1H-吡唑-3-基]氧基}-2-(甲氧基亚氨基)-N,3-二甲基戊-3-烯酰胺、(3.023) (2R)-2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺、(3.024) (2S)-2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺、(3.025) (3S,6S,7R,8R)-8-苄基-3-[[{3-[(异丁酰氧基)甲氧基]-4-甲氧基吡啶-2-基}羰基]氨基]-6-甲基-4,9-二氧化代-1,5-二氧杂环壬烷-7-基-2-甲基丙酸酯、(3.026) mandestrobin、(3.027) 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、(3.028) (2E,3Z)-5-{[1-(4-氯-2-氟苯基)-1H-吡唑-3-基]氧基}-2-(甲氧基亚氨基)-N,3-二甲基戊-3-烯酰胺、(3.029) {5-[3-(2,4-二甲基苯基)-1H-吡唑-1-基]-2-甲基苄基}氨基甲酸甲酯、(3.030)、metyltetraprole (3.031) florylpicoxamid。

[0259] 4)有丝分裂和细胞分裂抑制剂,例如(4.001)多菌灵(carbendazim)、(4.002)乙霉威(diethofencarb)、(4.003)噻唑菌胺(ethaboxam)、(4.004)氟吡菌胺(flupicolide)、(4.005)戊菌隆(pencycuron)、(4.006)噻菌灵(thiabendazole)、(4.007)甲基硫菌灵(thiophanate-methyl)、(4.008)苯酰菌胺(zoxamide)、(4.009) 3-氯-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基-5-苯基哒嗪、(4.010) 3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基哒嗪、(4.011) 3-氯-5-(6-氯吡啶-3-基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)哒嗪、(4.012) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.013) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.014) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.015) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.016) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.017) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.018) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、

(4.019) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.020) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.021) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.022) 4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基哒嗪、(4.023) N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.024) N-(2-溴苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.025) N-(4-氯-2,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺。

[0260] 5) 具有多位点作用能力的化合物,例如(5.001) 波尔多混合剂(Bordeaux mixture)、(5.002) 敌菌丹(captafol)、(5.003) 克菌丹(captan)、(5.004) 百菌清(chlorothalonil)、(5.005) 氢氧化铜、(5.006) 环烷酸铜、(5.007) 氧化铜、(5.008) 氯化铜、(5.009) 硫酸铜(2+)、(5.010) 二氰蒽醌(dithianon)、(5.011) 多果定(dodine)、(5.012) 灭菌丹(folpet)、(5.013) 代森锰锌(mancozeb)、(5.014) 代森锰(maneb)、(5.015) 代森联(metiram)、(5.016) 代森联锌(metiram zinc)、(5.017) 羟基喹啉铜(oxine-copper)、(5.018) 甲基代森锌(propineb)、(5.019) 硫和包括多硫化钙的硫制剂、(5.020) 福美双(thiram)、(5.021) 代森锌(zineb)、(5.022) 福美锌(ziram)、(5.023) 6-乙基-5,7-二氧代-6,7-二氢-5H-吡咯并[3',4':5,6][1,4]二噻英并[2,3-c][1,2]噻唑-3-甲腈。

[0261] 6) 能诱导宿主防御的化合物,例如(6.001) 阿拉酸式苯-S-甲基(acibenzolar-S-methyl)、(6.002) 异噻菌胺(isotianil)、(6.003) 烯丙苯噻唑(probenazole)、(6.004) 噻酰菌胺(tiadinil)。

[0262] 7) 氨基酸和/或蛋白质生物合成抑制剂,例如(7.001) 啞菌环胺(cyprodinil)、(7.002) 春雷霉素(kasugamycin)、(7.003) 春雷霉素盐酸盐水合物(kasugamycin hydrochloride hydrate)、(7.004) 氧四环素(oxytetracycline)、(7.005) 啞霉胺(pyrimethanil)、(7.006) 3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉。

[0263] 8) ATP产生抑制剂,例如(8.001) 硅噻菌胺(silthiofam)。

[0264] 9) 细胞壁合成抑制剂,例如(9.001) 苯噻菌胺(benthiavalicarb)、(9.002) 烯酰吗啉(dimethomorph)、(9.003) 氟吗啉(flumorph)、(9.004) 异丙菌胺(iprovalicarb)、(9.005) 双炔酰菌胺(mandipropamid)、(9.006) 吡吗啉(pyrimorph)、(9.007) 霜霉灭(valifenalate)、(9.008) (2E)-3-(4-叔丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(吗啉-4-基)丙-2-烯-1-酮、(9.009) (2Z)-3-(4-叔丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(吗啉-4-基)丙-2-烯-1-酮。

[0265] 10) 脂质和膜合成抑制剂,例如(10.001) 霜霉威(propamocarb)、(10.002) 霜霉威盐酸盐(propamocarb hydrochloride)、(10.003) 甲基立枯磷(tolclofos-methyl)。

[0266] 11) 黑色素生物合成抑制剂,例如(11.001) 三环唑(tricyclazole)、(11.002) 2,2,2-三氟乙基{3-甲基-1-[4-甲基苯甲酰基]氨基}丁-2-基}氨基甲酸酯。

[0267] 12) 核酸合成抑制剂,例如(12.001) 苯霜灵(benalaxyl)、(12.002) 精苯霜灵(benalaxyl-M)(kiralaxyl)、(12.003) 甲霜灵(metalaxyl)、(12.004) 高效甲霜灵(metalaxyl-M)(精甲霜灵(mefenoxam))。

[0268] 13) 信号转导抑制剂,例如(13.001) 咯菌腈(fludioxonil)、(13.002) 异菌脲(iprodione)、(13.003) 腐霉利(procymidone)、(13.004) 丙氧喹啉(proquinazid)、(13.005) 喹氧灵(quinoxifen)、(13.006) 乙烯菌核利(vinclozolin)。

[0269] 14) 能够用作解偶联剂的化合物,例如(14.001) 氟啶胺(fluzinam)、(14.002) 消螨多(meptyldinocap)。

[0270] 15) 其他化合物,例如(15.001) 脱落酸(Abscisic acid)、(15.002) 苯噻硫氰(benthiazole)、(15.003) bethoxazin、(15.004) 卡巴西霉素(capsimycin)、(15.005) 香芹酮(carvone)、(15.006) 灭螨猛(chinomethionat)、(15.007) 硫杂灵(cufraneb)、(15.008) 环氟菌胺(cyflufenamid)、(15.009) 霜脲氰(cymoxanil)、(15.010) 环丙磺酰胺(cyprosulfamide)、(15.011) flutianil、(15.012) 三乙膦酸铝(fosetyl-aluminium)、(15.013) 三乙膦酸钙(fosetyl-calcium)、(15.014) 三乙膦酸钠(fosetyl-sodium)、(15.015) 异硫氰酸甲酯(methyl isothiocyanate)、(15.016) 苯菌酮(metrafenone)、(15.017) 米多霉素(mildiomycin)、(15.018) 纳他霉素(natamycin)、(15.019) 福美镍(nickel dimethyldithiocarbamate)、(15.020) 酞菌酯(nitrothal-isopropyl)、(15.021) oxamocarb、(15.022) 氟噻唑吡乙酮(oxathiapiprolin)、(15.023) oxyfenthiin、(15.024) 五氯苯酚及其盐、(15.025) 亚磷酸及其盐、(15.026) 霜霉威乙膦酸盐(propamocarb-fosetylate)、(15.027) pyriofenone(chlazafenone)、(15.028) 异丁乙氧喹啉(tebufloquin)、(15.029) 叶枯酞(tecloftalam)、(15.030) 甲磺菌胺(tolnifanide)、(15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(15.033) 2-(6-苄基吡啶-2-基)喹唑啉、(15.034) dipymetitrone、(15.035) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-丙-2-炔-1-基氧基]苯基}-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基)-1,3-噻唑-2-基]哌啶-1-基]乙酮、(15.036) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.037) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.038) 2-[6-(3-氟-4-甲氧基苯基)-5-甲基吡啶-2-基]喹唑啉、(15.039) 2-[(5R)-3-[2-(1-[[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基]哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基]-3-氯苯基甲磺酸酯、(15.040) 2-[(5S)-3-[2-(1-[[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基]哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基]-3-氯苯基甲磺酸酯、(15.041) Ipflufenquin、(15.042) 2-{2-氟-6-[(8-氟-2-甲基喹啉-3-基)氧基]苯基}丙-2-醇、(15.043) 2-{3-[2-(1-[[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基]哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基}-3-氯苯基甲磺酸酯、(15.044) 2-{3-[2-(1-[[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基]哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基}苯基甲磺酸酯、(15.045) 2-苄基苯酚及盐、(15.046) 3-(4,4,5-三氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉、(15.047) quinofumelin、(15.048) 4-氨基-5-氟嘧啶-2-醇(互变异构形式:4-氨基-5-氟嘧啶-2(1H)-酮)、(15.049) 4-氧代-4-[(2-苄基)氨基]丁酸、(15.050) 5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇、(15.051) 5-氯-N'-苯基-N'-(丙-2-炔-1-基)噻吩-2-磺酰肼、(15.052) 5-氟-2-[(4-氟苄基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.053) 5-氟-2-[(4-甲基苄基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.054) 9-氟-2,2-二甲基-5-(喹啉-3-基)-2,3-二氢-1,4-苯并氧

杂吡啶因、(15.055) {6-[(Z)-(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基}氧基}甲基]吡啶-2-基}氨基甲酸丁-3-炔-1-基酯、(15.056) (2Z)-3-氨基-2-氰基-3-苯基丙烯酸乙酯、(15.057) 吩嗪-1-甲酸、(15.058) 3,4,5-三羟基苯甲酸丙酯、(15.059) 喹啉-8-醇、(15.060) 喹啉-8-醇硫酸酯(2:1)、(15.061) {6-[(Z)-(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基}氧基}甲基]吡啶-2-基}氨基甲酸叔丁酯、(15.062) 5-氟-4-亚氨基-3-甲基-1-[4-甲基苯基]磺酰基]-3,4-二氢嘧啶-2(1H)-酮、(15.063) aminopyrifen。

[0271] 本文中如上所述的(1)至(15)类的所有命名的混配物(mixing partner)均可以游离化合物和/或其农业上可接受的盐的形式(如果其官能团能够允许这样)存在。

[0272] 还可将式(I)的化合物和组合物与一种或多种生物防治剂结合。

[0273] 可与式(I)的化合物和包含其的组合物结合的生物防治剂的实例为:

[0274] (A) 选自以下的抗菌剂:

[0275] (A1) 细菌,如(A1.1) 枯草芽孢杆菌(*Bacillus subtilis*)、特别是菌株QST713/AQ713(可作为SERENADE OPTI或SERENADE ASO 从Bayer CropScience LP,US获得,NRRL登记号B21661并记载于US 专利号6060051中);(A1.2) 解淀粉芽孢杆菌(*Bacillus amyloliquefaciens*)、特别是菌株D747(可作为Double Nickel™从Certis, US获得,登记号FERM BP-8234并公开于US专利号7094592中);(A1.3) 短小芽孢杆菌(*Bacillus pumilus*)、特别是菌株BU F-33(NRRL 登记号50185);(A1.4) 解淀粉枯草芽孢杆菌变种(*Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens*) 菌株FZB24(可作为 **Taegro®**从Novozymes,US获得);(A1.5) 类芽孢杆菌属(*Paenibacillus* sp.) 菌株,登记号NRRL B-50972或登记号NRRL B-67129,并记载于国际专利公开号WO 2016/154297中;和

[0276] (A2) 真菌,例如(A2.1) 出芽短梗霉(*Aureobasidium pullulans*),特别是菌株DSM14940的芽生孢子;(A2.2) 出芽短梗霉,菌株DSM 14941的芽生孢子;(A2.3) 出芽短梗霉,特别是菌株DSM14940和 DSM14941的芽生孢子的混合物;

[0277] (B) 选自以下的杀真菌剂:

[0278] (B1) 细菌,例如(B1.1) 枯草芽孢杆菌、特别是菌株QST713/AQ713 (可作为SERENADE OPTI或SERENADE ASO从Bayer CropScience LP,US获得,NRRL登记号B21661并记载于US专利号6060051中);(B1.2) 短小芽孢杆菌、特别是菌株QST2808(可作为 **SONATA®**从 Bayer CropScience LP,US获得,登记号NRRL B-30087并记载于US 专利号6245551中);(B1.3) 短小芽孢杆菌、特别是菌株GB34(可作为Yield **Shield®**从Bayer AG,DE获得);(B1.4) 短小芽孢杆菌、特别是菌株BU F-33(NRRL登记号50185);(B1.5) 解淀粉芽孢杆菌、特别是菌株D747(可作为Double Nickel™从Certis,US获得,登记号FERM BP-8234并公开于US专利号7094592中);(B1.6) 枯草芽孢杆菌Y1336(可作为 **BIOBAC®** WP从Bion-Tech,中国台湾获得,在中国台湾注册为生物杀真菌剂,注册号4764、5454、5096和5277);(B1.7) 解淀粉芽孢杆菌菌株MBI 600(可作为SUBTILEX从BASF SE获得);(B1.8) 枯草芽孢杆菌菌株GB03(可作为 **Kodiak®**从Bayer AG,DE 获得);(B1.9) 解淀粉枯草芽孢杆菌变种菌株FZB24(可作为杀真菌剂 **TAEGRO®**或 **TAEGRO®** ECO(EPA注册号70127-5)从Novozymes Biologicals Inc.,Salem,Virginia或Syngenta Crop Protection,LLC,

Greensboro, North Carolina获得); (B1.10) 蕈状芽胞杆菌 (*Bacillus mycoides*), 分离株J (可作为BmJ TGA1或WG从Certis USA获得); (B1.11) 地衣芽胞杆菌 (*Bacillus licheniformis*)、特别是菌株SB3086 (可作为EcoGuard™ Biofungicide和Green Releaf从Novozymes获得); (B1.12) 类芽胞杆菌属菌株, 登记号NRRL B-50972或登记号 NRRL B-67129, 并记载于国际专利公开号W0 2016/154297中。

[0279] 在一些实施方案中, 生物防治剂为产生泛革素 (fengycin) 型化合物或制磷脂菌素 (plipastatin) 型化合物、伊枯草素 (iturin) 型化合物和/或表面活性素 (surfactin) 型化合物的枯草芽胞杆菌菌株或解淀粉芽胞杆菌菌株。关于背景, 参见以下综述文章: Ongena, M. 等人, “*Bacillus Lipopeptides: Versatile Weapons for Plant Disease Biocontrol*,” *Trends in Microbiology*, 第16卷, 第3期, 2008年3月, 第115-125页。能够产生脂肽的芽胞杆菌菌株包括枯草芽胞杆菌QST713 (可作为SERENADE OPTI或SERENADE ASO从Bayer CropScience LP, US获得, NRRL 登记号B21661并记载于US专利号6060051中)、解淀粉芽胞杆菌菌株D747 (可作为Double Nickel™从Certis, US获得, 登记号FERM BP-8234并公开于US专利号7094592中); 枯草芽胞杆菌MBI600 (可作为**SUBTILEX**®从Becker Underwood, US EPA获得, 登记号 71840-8); 枯草芽胞杆菌Y1336 (可作为**BIOBAC**® WP从Bion-Tech, 中国台湾获得, 在中国台湾注册为生物杀真菌剂, 登记号4764、5454、5096和5277); 解淀粉芽胞杆菌、特别是菌株FZB42 (可作为**RHIZOVITAL**®从ABiTEP, DE获得); 和解淀粉枯草芽胞杆菌变种FZB24 (可作为杀真菌剂**TAEGRO**®或**TAEGRO**® ECO (EPA注册号70127-5)从Novozymes Biologicals Inc., Salem, Virginia或Syngenta Crop Protection, LLC, Greensboro, North Carolina获得); 和

[0280] (B2) 真菌, 例如: (B2.1) 盾壳霉 (*Coniothyrium minitans*)、特别是菌株CON/M/91-8 (登记号DSM-9660; 例如购自Bayer的**Contans**®); (B2.2) 核果梅奇酵母 (*Metschnikowia fructicola*)、特别是菌株 NRRL Y-30752 (例如**Shemer**®); (B2.3) 小球壳孢 (*Microsphaeropsis ochracea*) (例如购自Prophyta的**Microx**®); (B2.5) 木霉属 (*Trichoderma* spp.), 包括深绿木霉 (*Trichoderma atroviride*), 记载于国际申请号PCT/IT2008/000196中的菌株SC1; (B2.6) 哈茨木霉 (*Trichoderma harzianum rifai*) 菌株KRL-AG2 (也称作菌株T-22, /ATCC 208479, 例如购自BioWorks, US的PLANTSHIELD T-22G、**Rootshield**®和TurfShield); (B2.14) 粉红粘帚霉 (*Gliocladium roseum*), 购自W.F.Stoneman Company LLC的菌株321U; (B2.35) 黄色蠕形霉 (*Talaromyces flavus*), 菌株V117b; (B2.36) 棘孢木霉 (*Trichoderma asperellum*), 购自Isagro的菌株ICC 012; (B2.37) 棘孢木霉, 菌株SKT-1 (例如购自Kumiai Chemical Industry的ECO-**HOPE**®); (B2.38) 深绿木霉, 菌株CNCM I-1237 (例如购自Agrauxine, FR的**Esquive**® WP); (B2.39) 深绿木霉, 菌株号 V08/002387; (B2.40) 深绿木霉, 菌株NMI号V08/002388; (B2.41) 深绿木霉, 菌株NMI号V08/002389; (B2.42) 深绿木霉, 菌株NMI 号V08/002390; (B2.43) 深绿木霉, 菌株LC52 (例如Agrimm Technologies Limited的Tenet); (B2.44) 深绿木霉, 菌株ATCC 20476 (IMI 206040); (B2.45) 深绿木霉, 菌株T11 (IMI352941/CECT20498); (B2.46) 钩状

木霉 (*Trichoderma harmatum*) ; (B2.47) 哈茨木霉 ; (B2.48) 哈茨木霉 T39 (例如购自 Makhteshim, US 的 **Trichodex®**) ; (B2.49) 哈茨木霉、特别是菌株 KD (例如购自 Biological Control Products, SA (被 Becker Underwood 收购) 的 *Trichoplus*) ; (B2.50) 哈茨木霉, 菌株 ITEM 908 (例如购自 Koppert 的 *Trianium-P*) ; (B2.51) 哈茨木霉, 菌株 TH35 (例如 Mycontrol 的 *Root-Pro*) ; (B2.52) 绿木霉 (*Trichoderma virens*) (也称作绿粘帚霉 (*Gliocladium virens*))、特别是菌株 GL-21 (例如 Certis, US 的 *SoilGard 12G*) ; (B2.53) 绿色木霉 (*Trichoderma viride*) , 菌株 TV1 (例如 Koppert 的 *Trianium-P*) ; (B2.54) 白粉寄生孢 (*Ampelomyces quisqualis*)、特别是菌株 AQ 10 (例如 IntrachemBio Italia 的 **AQ10®**) ; (B2.56) 出芽短梗霉、特别是菌株 DSM14940 的芽生孢子 ; (B2.57) 出芽短梗霉、特别是菌株 DSM 14941 的芽生孢子 ; (B2.58) 出芽短梗霉、特别是菌株 DSM14940 和 DSM 14941 的芽生孢子的混合物 (例如 bio-ferm, CH 的 **Botector®**) ; (B2.64) 芽枝状枝孢 (*Cladosporium cladosporioides*) , 菌株 H39 (Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoek) ; (B2.69) 链孢粘帚菌 (*Gliocladium catenulatum*) (同义词: *Clonostachys rosea f. catenulate*) 菌株 J1446 (例如 AgBio Inc. 的 **Prestop®** , 以及例如 Kemira Agro Oy 的 **Primastop®**) ; (B2.70) 蜡蚧轮枝菌 (*Lecanicillium lecanii*) (先前称为蜡蚧轮枝孢 (*Verticillium lecanii*)) , 菌株 KV01 的分生孢子 (例如 Koppert/Arysta 的 **Vertalec®**) ; (B2.71) 蠕形青霉 (*Penicillium vermiculatum*) ; (B2.72) 异常毕赤酵母 (*Pichia anomala*) , 菌株 WRL-076 (NRRL Y-30842) ; (B2.75) 深绿木霉, 菌株 SKT-1 (FERM P-16510) ; (B2.76) 深绿木霉, 菌株 SKT-2 (FERM P-16511) ; (B2.77) 深绿木霉, 菌株 SKT-3 (FERM P-17021) ; (B2.78) 盖姆斯木霉 (*Trichoderma gamsii*) (原绿色木霉 (*T. viride*)) , 菌株 ICC080 (IMI CC 392151CABI, 例如 AGROBIOSOL DE MEXICO, S.A. DE C.V. 的 *BioDerma*) ; (B2.79) 哈茨木霉, 菌株 DB 103 (例如 Dagutat Biolab 的 *T-Gro 7456*) ; (B2.80) 多孢木霉 (*Trichoderma polysporum*) , 菌株 IMI 206039 (例如 BINAB Bio-Innovation AB, Sweden 的 *Binab TF WP*) ; (B2.81) 子座木霉 (*Trichoderma stromaticum*) (例如 Ceplac, Brazil 的 *Tricovab*) ; (B2.83) 奥德曼细基格孢 (*Ulocladium oudemansii*)、特别是菌株 HRU3 (例如 Botry-Zen Ltd, NZ 的 **Botry-Zen®**) ; (B2.84) 黑白轮枝孢 (*Verticillium albo-atrum*) (原大丽轮枝菌 (*V. dahliae*)) , 菌株 WCS850 (CBS 276.92; 例如 Tree Care Innovations 的 *Dutch Trig*) ; (B2.86) 厚垣轮枝孢菌 (*Verticillium chlamyosporium*) ; (B2.87) 棘孢木霉菌株 ICC 012 和盖姆斯木霉菌株 ICC 080 的混合物 (称作例如 BIO-TAM™ 的产品, 购自 Bayer CropScience LP, US)。

[0281] 可与式 (I) 的化合物和包含其的组合物结合的生物防治剂的其他实例为:

[0282] 选自以下的细菌: 蜡样芽胞杆菌 (*Bacillus cereus*)、特别是蜡样芽胞杆菌菌株 CNCM I-1562 和坚强芽胞杆菌 (*Bacillus firmus*) 菌株 I-1582 (登记号 CNCM I-1582) ; 枯草芽胞杆菌菌株 OST 30002 (登记号 NRRL B-50421) ; 苏云金芽胞杆菌 (*Bacillus thuringiensis*) , 特别是苏云金芽胞杆菌以色列亚种 (*B. thuringiensis subspecies israelensis*) (血清型 H-14) , 菌株 AM65-52 (登记号 ATCC 1276) ; 苏云金芽胞杆菌鲎泽亚种 (*B. thuringiensis subsp. aizawai*) , 特别是菌株 ABTS-1857 (SD-1372) ; 苏云金芽胞杆菌库尔斯塔克亚种 (*B. thuringiensis subsp. kurstaki*) 菌株 HD-1 ; 苏云金芽胞杆菌拟步行甲亚种菌株 NB 176 (SD-5428) ; 穿刺芽胞杆菌 (*Pasteuria penetrans*) ; 巴斯德氏芽菌属

(*Pasteuria* spp.) (肾形线虫 (*Rotylenchulus reniformis* nematode)) -PR3 (登记号 ATCC SD-5834); 细黄链霉菌 (*Streptomyces microflavus*) 菌株 AQ6121 (=QRD 31.013, NRRL B-50550); 和鲜黄链霉菌 (*Streptomyces galbus*) 菌株 AQ 6047 (登记号 NRRL 30232);

[0283] 选自以下的真菌和酵母: 球孢白僵菌 (*Beauveria bassiana*), 特别是菌株 ATCC 74040; 蜡蚧菌属 (*Lecanicillium* spp.), 特别是菌株 HRO LEC 12; 绿僵菌 (*Metarhizium anisopliae*), 特别是菌株 F52 (DSM3884 或 ATCC 90448); 玫烟色拟青霉 (*Paecilomyces fumosoroseus*) (现用名: 玫烟色棒束孢 (*Isaria fumosorosea*)), 特别是菌株 IFPC 200613, 或菌株 Apopka 97 (登记号 ATCC 20874); 和淡紫色拟青霉 (*Paecilomyces lilacinus*), 特别是淡紫色拟青霉菌株 251 (AGAL 89/030550);

[0284] 选自以下的病毒: 棉褐带卷蛾 (*Adoxophyes orana*) (夏季水果卷叶蛾 (summer fruit tortrix)) 颗粒体病毒 (GV)、苹果蠹蛾 (*Cydia pomonella*) (codling moth) 颗粒体病毒 (GV)、棉铃虫 (*Helicoverpa armigera*) (cotton bollworm) 核多角体病毒 (NPV)、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua*) (beet armyworm) mNPV、草地贪夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*) (fall armyworm) mNPV 和海灰翅夜蛾 (*Spodoptera littoralis*) (非洲棉叶虫 (African cotton leafworm)) NPV。

[0285] 作为“接种体”添加到植物或植物部位或植物器官并凭借其特定性能促进植物生长和植物健康的细菌和真菌。实例为: 土壤杆菌属 (*Agrobacterium* spp.), 茎瘤固氮根瘤菌 (*Azorhizobium caulinodans*), 固氮螺菌属 (*Azospirillum* spp.), 固氮菌属 (*Azotobacter* spp.), 慢生根瘤菌属 (*Bradyrhizobium* spp.), 伯克霍尔德菌属 (*Burkholderia* spp.), 特别是洋葱伯克霍尔德菌 (*Burkholderia cepacia*) (先前称为洋葱假单胞菌 (*Pseudomonas cepacia*)), 巨孢囊霉属 (*Gigaspora* spp.) 或 *Gigaspora monosporum*, 球囊霉属 (*Glomus* spp.), 蜡蘑属 (*Laccaria* spp.), 布氏乳杆菌 (*Lactobacillus buchneri*), 类球囊霉属 (*Paraglomus* spp.), *Pisolithus tinctorus*, 假单胞菌属 (*Pseudomonas* spp.), 根瘤菌属 (*Rhizobium* spp.), 特别是三叶草根瘤菌 (*Rhizobium trifolii*), 须腹菌属 (*Rhizopogon* spp.), 硬皮马勃属 (*Scleroderma* spp.), 乳牛肝菌属 (*Suillus* spp.) 和链霉菌属 (*Streptomyces* spp.)。

[0286] 可用作生物防治剂的植物提取物和由微生物形成的包括蛋白质和次生代谢物的产物, 例如大蒜 (*Allium sativum*)、苦艾 (*Artemisia absinthium*)、印楝素 (azadirachtin)、Biokeeper WP、*Cassia nigricans*、苦皮藤 (*Celastrus angulatus*)、*Chenopodium anthelminticum*、几丁质、Armour-Zen、欧洲鳞毛蕨 (*Dryopteris filix-mas*)、问荆 (*Equisetum arvense*)、Fortune Aza、Fungastop、Heads Up (藜麦皂苷提取物 (*Chenopodium quinoa saponin extract*))、除虫菊 (Pyrethrum) / 除虫菊酯 (Pyrethrins)、苏里南苦木 (*Quassia amara*)、栎 (*Quercus*)、皂树 (*Quillaja*)、Regalia、“Requiem<sup>TM</sup> 杀昆虫剂”、鱼藤酮 (rotenone)、鱼尼丁 (ryania) / 兰尼碱 (ryanodine)、聚合草 (*Symphytum officinale*)、菊蒿 (*Tanacetum vulgare*)、百里酚 (thymol)、Triact 70、TriCon、*Tropaeolum majus*、大荨麻 (*Urtica dioica*)、藜芦碱 (Veratrin)、白槲寄生 (*Viscum album*)、十字花科 (Brassicaceae) 提取物 (特别是油菜粉或芥菜粉)。

[0287] 可分别与式 (I) 的化合物和包含其的组合物混合的杀昆虫剂、杀螨剂和杀线虫剂的实例为:

[0288] (1) 乙酰胆碱酯酶 (AChE) 抑制剂, 例如氨基甲酸酯类, 例如棉铃威 (alanycarb)、涕灭威 (aldicarb)、噁虫威 (bendiocarb)、丙硫克百威 (benfuracarb)、丁酮威 (butocarboxim)、丁酮砜威 (butoxycarboxim)、甲萘威 (carbaryl)、克百威 (carbofuran)、丁硫克百威 (carbosulfan)、乙硫苯威 (ethiofencarb)、仲丁威 (fenobucarb)、伐虫脒 (formetanate)、呋线威 (furathiocarb)、异丙威 (isoprocarb)、甲硫威 (methiocarb)、灭多威 (methomyl)、速灭威 (metolcarb)、杀线威 (oxamyl)、抗蚜威 (pirimicarb)、残杀威 (propoxur)、硫双威 (thiodicarb)、久效威 (thiofanox)、啉蚜威 (triazamate)、混杀威 (trimethacarb)、灭除威 (XMC) 和灭杀威 (xylylcarb); 或有机磷酸酯类, 例如乙酰甲胺磷 (acephate)、甲基吡啶磷 (azamethiphos)、乙基谷硫磷 (azinphos-ethyl)、甲基谷硫磷 (azinphos-methyl)、硫线磷 (cadusafos)、氯氧磷 (chlorethoxyfos)、毒虫畏 (chlorfenvinphos)、氯甲硫磷 (chlormephos)、甲基毒死蜱 (chlorpyrifos-methyl)、蝇毒磷 (coumaphos)、杀螟腈 (cyanophos)、甲基内吸磷 (demeton-S-methyl)、二嗪农 (diazinon)、敌敌畏 (dichlorvos)/DDVP、百治磷 (dicrotophos)、乐果 (dimethoate)、甲基毒虫畏 (dimethylvinphos)、乙拌磷 (disulfoton)、苯硫磷 (EPN)、乙硫磷 (ethion)、灭线磷 (ethoprophos)、伐灭磷 (famphur)、苯线磷 (fenamiphos)、杀螟硫磷 (fenitrothion)、倍硫磷 (fenthion)、噻唑膦 (fosthiazate)、庚烯磷 (heptenophos)、imicyafos、异柳磷 (isofenphos)、0-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸异丙酯 (isopropyl 0-(methoxyaminothiophosphoryl) salicylate)、异噁唑磷 (isoxathion)、马拉松 (malathion)、灭蚜磷 (mecarbam)、甲胺磷 (methamidophos)、杀扑磷 (methidathion)、速灭磷 (mevinphos)、久效磷 (monocrotophos)、二溴磷 (naled)、氧乐果 (omethoate)、亚砷磷 (oxydemeton-methyl)、甲基对硫磷 (parathion-methyl)、稻丰散 (phenthoate)、甲拌磷 (phorate)、伏杀硫磷 (phosalone)、亚胺硫磷 (phosmet)、磷胺 (phosphamidon)、辛硫磷 (phoxim)、甲基嘧啶磷 (pirimiphos-methyl)、丙溴磷 (profenofos)、胺丙畏 (propetamphos)、丙硫磷 (prothiofos)、吡啶硫磷 (pyraclofos)、吡嗪硫磷 (pyridaphenthion)、喹硫磷 (quinalphos)、治螟磷 (sulfotep)、丁基嘧啶磷 (tebupirimfos)、双硫磷 (temephos)、特丁硫磷 (terbufos)、杀虫畏 (tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷 (thiometon)、三唑磷 (triazophos)、敌百虫 (trichlorfon) 和蚜灭磷 (vamidothion)。

[0289] (2) GABA门控氯化物通道阻断剂, 例如环戊二烯有机氯类, 例如氯丹 (chlordane) 和硫丹 (endosulfan), 或苯基吡唑类 (phenylpyrazoles (fiproles)), 例如乙虫腈 (ethiprole) 和氟虫腈 (fipronil)。

[0290] (3) 钠通道调节剂, 例如拟除虫菊酯类 (pyrethroids), 例如氟丙菊酯 (acrinathrin)、丙烯菊酯 (allethrin)、d-顺式-反式丙烯菊酯、d-反式丙烯菊酯、联苯菊酯 (bifenthrin)、生物丙烯菊酯 (bioallethrin)、生物丙烯菊酯s-环戊烯基同分异构体、生物苜蓿菊酯 (bioresmethrin)、乙氰菊酯 (cycloprothrin)、氟氯氰菊酯 (cyfluthrin)、β-氟氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯 (cyhalothrin)、λ-三氟氯氰菊酯、γ-三氟氯氰菊酯、氯氰菊酯 (cypermethrin)、α-氯氰菊酯、β-氯氰菊酯、θ-氯氰菊酯、ζ-氯氰菊酯、苯醚氰菊酯 [(1R)-反式同分异构体] (cyphenothrin [(1R)-trans isomer])、溴氰菊酯 (deltamethrin)、右旋烯炔菊酯 [(EZ)-(1R)同分异构体] (empenthrin [(EZ)-(1R) isomer])、高氰戊菊酯

(esfenvalerate)、醚菊酯(etofenprox)、甲氰菊酯(fenpropathrin)、氰戊菊酯(fenvalerate)、氟氰戊菊酯(flucythrinate)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、 $\tau$ -氟胺氰菊酯(tau-fluvalinate)、苜蓿醚(halfenprox)、炔咪菊酯(imiprothrin)、噻噁菊酯(kadethrin)、momfluorothrin、氯菊酯(permethrin)、苯醚菊酯[(1R)-反式同分异构体](phenothrin[(1R)-trans isomer])、右旋炔丙菊酯(prallethrin)、除虫菊素(除虫菊)(pyrethrins(pyrethrum))、苜蓿菊酯(resmethrin)、氟硅菊酯(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin)、胺菊酯(tetramethrin)、胺菊酯[(1R)同分异构体](tetramethrin[(1R) isomer])、四溴菊酯(tralomethrin)和四氟苯菊酯(transfluthrin)或滴滴涕(DDT)或甲氧滴滴涕(methoxychlor)。

[0291] (4) 烟碱能乙酰胆碱受体(nAChR)竞争调节剂,例如新烟碱类(neonicotinoids),例如啉虫脒(acetamiprid)、噁虫胺(clothianidin)、呋虫胺(dinotefuran)、吡虫啉(imidacloprid)、烯啉虫胺(nitenpyram)、噁虫啉(thiacloprid)和噁虫嗪(thiamethoxam),或烟碱(nicotine),或氟啉虫胺脒(sulfoxaflor),或氟吡呋喃酮(flupyradifurone)。

[0292] (5) 烟碱能乙酰胆碱受体(nAChR)变构调节剂,例如多杀菌素类(spinosyns),例如乙基多杀菌素(spinetoram)和多杀菌素(spinosad)。

[0293] (6) 谷氨酸酯门控氯化物通道(GluCl)变构调节剂,例如阿维菌素类(avermectins)/米尔倍霉素类(milbemycins),例如阿维菌素(abamectin)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐(emamectin benzoate)、雷皮菌素(lepimectin)和弥拜菌素(milbemectin)。

[0294] (7) 保幼激素模拟物,例如保幼激素类似物,例如烯虫乙酯(hydroprene)、烯虫炔酯(kinoprene)和烯虫酯(methoprene),或苯氧威(fenoxycarb)或吡丙醚(pyriproxyfen)。

[0295] (8) 其他非特异性(多位点)抑制剂,例如烷基卤化物类,例如甲基溴和其他烷基卤化物;或氯化苦(chloropicrine)或硫酰氟(sulphuryl fluoride)或硼砂(borax)或吐酒石(tartar emetic)或异氰酸甲酯产生剂,例如diazomet和威百亩(metam)。

[0296] (9) 弦音器官(chordotonal organ)调节剂,例如吡蚜酮(pymetrozine)或氟啉虫酰胺(flonicamid)。

[0297] (10) 螨生长抑制剂,例如四螨嗪(clofentezine)、噁螨酮(hexythiazox)和氟螨嗪(diflovidazin),或乙螨唑(etoxazole)。

[0298] (11) 昆虫中肠膜微生物干扰剂,例如苏云金芽孢杆菌以色列亚种、球形芽孢杆菌(Bacillus sphaericus)、苏云金芽孢杆菌鲇泽亚种、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种和B. t. 植物蛋白:Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/35Ab1。

[0299] (12) 线粒体ATP合酶抑制剂,例如ATP干扰剂,例如丁醚脲(diafenthiuron),或有机锡化合物类,例如三唑锡(azocyclotin)、三环锡(cyhexatin)和苯丁锡(fenbutatin oxide),或炔螨特(propargite),或四氯杀螨砜(tetradifon)。

[0300] (13) 通过间隔质子梯度作用的氧化磷酸化解偶联剂,例如溴虫脒(chlorfenapyr)、二硝甲酚(DNOC)和氟虫胺(sulfluramid)。

[0301] (14) 烟碱能乙酰胆碱受体通道阻断剂,例如杀虫磺(bensultap)、杀螟丹盐酸盐(cartap hydrochloride)、杀虫环(thiocyclam)和杀虫双(thiosultap-sodium)。

- [0302] (15) 0型几丁质生物合成抑制剂,例如双三氟虫脲(bistrifluron)、定虫隆(chlorfluazuron)、二氟脲(diflubenzuron)、氟环脲(flucycloxuron)、氟虫脲(flufenoxuron)、氟铃脲(hexaflumuron)、虱螨脲(lufenuron)、氟酰脲(novaluron)、多氟脲(noviflumuron)、氟苯脲(teflubenzuron)和杀铃脲(triflumuron)。
- [0303] (16) 1型几丁质生物合成抑制剂,例如噻嗪酮(buprofezin)。
- [0304] (17) 蜕皮干扰剂(特别是对于双翅目(Diptera),即双翅类昆虫(dipterans)),例如灭蝇胺(cyromazine)。
- [0305] (18) 蜕皮激素受体激动剂,例如环虫酰肼(chromafenozide)、氯虫酰肼(halofenozide)、甲氧虫酰肼(methoxyfenozide)和虫酰肼(tebufenozide)。
- [0306] (19) 章鱼胺受体激动剂,例如双甲脒(amitraz)。
- [0307] (20) 线粒体复合物III电子传递抑制剂,例如氟蚁腓(hydramethylnon)或灭螨醌(acequinocyl)或啞螨酯(flucrypyrim)。
- [0308] (21) 线粒体复合物I电子传递抑制剂,例如METI杀螨剂类,例如喹螨醚(fenazaquin)、啞螨酯(fenpyroximate)、啞螨醚(pyrimidifen)、啞螨灵(pyridaben)、吡螨胺(tebufenpyrad)和啞虫酰胺(tolfenpyrad),或鱼藤酮(rotenone)(鱼藤属(Derris))。
- [0309] (22) 电压依赖型钠通道阻断剂,例如茚虫威(indoxacarb)或氰氟虫脒(metaflumizone)。
- [0310] (23) 乙酰基辅酶A(CoA)羧化酶抑制剂,例如特窗酸和特特拉姆酸(tetramic acid)衍生物,例如螺螨酯(spirodiclofen)、螺甲螨酯(spiromesifen)和螺虫乙酯(spirotetramat)。
- [0311] (24) 线粒体复合物IV电子传递抑制剂,例如膦类化合物,例如磷化铝、磷化钙、膦和磷化锌,或氰化物类,例如氰化钙、氰化钾和氰化钠。
- [0312] (25) 线粒体复合物II电子传递抑制剂,例如 $\beta$ -酮腈衍生物类(beta-keto nitrile derivatives),例如腈吡螨酯(cyenopyrafen)和丁氟螨酯(cyflumetofen)和羧酰苯胺类(carboxanilide),例如pyflubumide。
- [0313] (28) 兰尼碱(ryanodine)受体调节剂,例如二酰胺类,例如氯虫苯甲酰胺(chlorantraniliprole)、氰虫酰胺(cyantraniliprole)和氟虫双酰胺(flubendiamide),
- [0314] 其他活性成分,例如啞喃环丙虫酯(Afidopyropen)、阿福拉纳(Afoxolaner)、印楝素(Azadirachtin)、Benclotiaz、苯螨特(Benzoximate)、联苯肼酯(Bifenazate)、溴虫氟苯双酰胺(Broflanilide)、溴螨酯(Bromopropylate)、灭螨猛(Chinomethionat)、氯丙炔菊酯(Chloroprallethrin)、冰晶石(Cryolite)、环溴虫酰胺(Cyclaniliprole)、环氧虫啞(Cyclozaprid)、氯氟氰虫酰胺(Cyhalodiamide)、Dicloromezotiaz、三氯杀螨醇(Dicofol)、 $\epsilon$ -甲氧苄氟菊酯(epsilon-Metofluthrin)、epsilon-Momfluthrin、Flumetoquin、Fluazaindolizine、联氟砒(Fluensulfone)、啞虫胺(Flufenerim)、氟菌螨酯(Flufenoxystrobin)、丁虫腈(Flufiprole)、Fluhexafon、氟吡菌酰胺(Fluopyram)、氟雷拉纳(Fluralaner)、Fluxametamide、呋喃虫酰肼(Fufenozide)、戊吡虫胍(Guadipyr)、Heptafluthrin、氯噁啉(Imidaclothiz)、异菌脲(Iprodione)、 $\kappa$ -联苯菊酯(kappa-Bifenthrin)、 $\kappa$ -七氟菊酯(kappa-Tefluthrin)、Lotilaner、氯氟醚菊酯(Meperfluthrin)、啞虫啞(Paichongding)、啞虫丙醚(Pyridalyl)、Pyrifluquinazon、啞螨胺

(Pyriminostrobin)、Spirobudiclofen、四氟醚菊酯(Tetramethylfluthrin)、氟氰虫酰胺(Tetraniliprole)、四氯虫酰胺(Tetrachlorantraniliprole)、Tigolaner、Tioxazafen、硫氟脒(Thiofluoximate)、三氟苯嘧啶(Triflumezopyrim) 和碘甲烷(iodomethane);此外,基于坚强芽孢杆菌的制剂(I-1582, BioNeem, Votivo),以及以下化合物:1-{2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亚磺酰基]苯基}-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺(由W02006/043635获知)(CAS 885026-50-6)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吡啶-3,4'-哌啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮(由W02003/106457获知)(CAS 637360-23-7)、2-氯-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]哌啶-4-基}-4-(三氟甲基)苯基]异烟酰胺(由W02006/003494获知)(CAS 872999-66-1)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-4-羟基-8-甲氧基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(由W0 2010052161获知)(CAS 1225292-17-0)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙基碳酸酯(由EP 2647626获知)(CAS-1440516-42-6)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基哌啶-1-基)-5-氟嘧啶(由W02004/099160获知)(CAS 792914-58-0)、PF1364(由JP2010/018586获知)(CAS 1204776-60-2)、N-[(2E)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]吡啶-2(1H)-亚基]-2,2,2-三氟乙酰胺(由W02012/029672获知)(CAS 1363400-41-2)、(3E)-3-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-吡啶亚基]-1,1,1-三氟丙-2-酮(由W02013/144213获知)(CAS 1461743-15-6)、N-[3-(苄基氨基甲酰基)-4-氯苯基]-1-甲基-3-(五氟乙基)-4-(三氟甲基)-1H-吡啶-5-甲酰胺(由W02010/051926获知)(CAS 1226889-14-0)、5-溴-4-氯-N-[4-氯-2-甲基-6-(甲基氨基甲酰基)苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)吡啶-3-甲酰胺(由CN103232431获知)(CAS 1449220-44-3)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-甲基-N-(顺式-1-氧代-3-硫杂环丁烷基)苯甲酰胺、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-甲基-N-(反式-1-氧代-3-硫杂环丁烷基)苯甲酰胺和4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-甲基-N-(顺式-1-氧代-3-硫杂环丁烷基)苯甲酰胺(由W0 2013/050317 A1获知)(CAS 1332628-83-7)、N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡啶-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亚磺酰基]丙酰胺、(+)-N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡啶-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亚磺酰基]丙酰胺和(-)-N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡啶-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亚磺酰基]丙酰胺(由W0 2013/162715 A2、W0 2013/162716 A2、US 2014/0213448 A1获知)(CAS 1477923-37-7)、5-[[ (2E)-3-氯-2-丙烯-1-基]氨基]-1-[2,6-二氯-4-(三氟甲基)苯基]-4-[(三氟甲基)亚磺酰基]-1H-吡啶-3-甲腈(由CN 101337937A获知)(CAS 1105672-77-2)、3-溴-N-[4-氯-2-甲基-6-[(甲基氨基)硫代甲基]苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡啶-5-甲酰胺(Liudaibenjiaxuanan,由CN 103109816 A获知)(CAS 1232543-85-9)、N-[4-氯-2-[[ (1,1-二甲基乙基)氨基]羰基]-6-甲基苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(氟甲氧基)-1H-吡啶-5-甲酰胺(由W0 2012/034403A1获知)(CAS 1268277-22-0)、N-[2-(5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡啶-5-甲酰胺(由W0 2011/085575 A1获知)(CAS 1233882-22-8)、4-[3-[2,6-二氯-4-[(3,3-二氯-2-丙烯-1-基)氧基]苯氧基]丙氧基]-2-甲氧基-6-(三氟甲基)嘧啶(由CN 101337940 A获知)(CAS 1108184-52-6)、(2E)-2-[2-(4-氰基苯基)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]-N-[4-(二氟甲氧基)苯基]肼甲酰胺和2(Z)-2-[2-(4-氰基苯基)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚

乙基]-N-[4-(二氟甲氧基)苯基]肼甲酰胺(由CN 101715774 A获知)(CAS 1232543-85-9)、环丙烷甲酸3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基-4-(1H-苯并咪唑-2-基)苯酯(由CN 103524422 A获知)(CAS 1542271-46-4)、(4aS)-7-氯-2,5-二氢-2-[[[(甲氧基羰基)[4-[(三氟甲基)硫基]苯基]氨基]羰基]-茛并[1,2-e][1,3,4]噁二嗪-4a(3H)-甲酸甲酯(由CN 102391261 A获知)(CAS 1370358-69-2)、6-脱氧-3-O-乙基-2,4-二-O-甲基-, 1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-五氟乙氧基)苯基]-1H-1,2,4-三唑-3-基]苯基]氨基甲酸酯]- $\alpha$ -L-吡喃甘露糖(由US 2014/0275503 A1获知)(CAS 1181213-14-8)、8-(2-环丙基甲氧基-4-三氟甲基苯氧基)-3-(6-三氟甲基哒嗪-3-基)-3-氮杂二环[3.2.1]辛烷(CAS 1253850-56-4)、(8-反式)-8-(2-环丙基甲氧基-4-三氟甲基苯氧基)-3-(6-三氟甲基哒嗪-3-基)-3-氮杂二环[3.2.1]辛烷(CAS 933798-27-7)、(8-顺式)-8-(2-环丙基甲氧基-4-三氟甲基苯氧基)-3-(6-三氟甲基哒嗪-3-基)-3-氮杂二环[3.2.1]辛烷(由WO 2007040280 A1、WO 2007040282 A1获知)(CAS 934001-66-8)、N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)硫基]-丙酰胺(由WO 2015/058021 A1、WO 2015/058028 A1获知)(CAS 1477919-27-9)和N-[4-(氨基硫代甲基)-2-甲基-6-[(甲基氨基)羰基]苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-甲酰胺(由CN 103265527 A获知)(CAS 1452877-50-7)、5-(1,3-二氧杂环己-2-基)-4-[[4-(三氟甲基)苯基]甲氧基]嘧啶(由WO 2013/115391 A1获知)(CAS 1449021-97-9)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-4-羟基-8-甲氧基-1-甲基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(由WO 2010/066780 A1、WO 2011/151146 A1获知)(CAS 1229023-34-0)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-1-甲基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-2,4-二酮(由WO 2014/187846 A1获知)(CAS 1638765-58-8)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-1-甲基-2-氧代-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基碳酸乙酯(由WO 2010/066780 A1、WO 2011/151146 A1获知)(CAS 1229023-00-0)、N-[1-[6-氯-3-吡啶基]甲基]-2(1H)-吡啶亚基]-2,2,2-三氟乙酰胺(由DE 3639877 A1、WO 2012029672 A1获知)(CAS 1363400-41-2)、[N(E)]-N-[1-[6-氯-3-吡啶基]甲基]-2(1H)-吡啶亚基]-2,2,2-三氟乙酰胺(由WO 2016005276 A1获知)(CAS 1689566-03-7)、[N(Z)]-N-[1-[6-氯-3-吡啶基]甲基]-2(1H)-吡啶亚基]-2,2,2-三氟乙酰胺(CAS 1702305-40-5)、3-内型-3-[2-丙氧基-4-(三氟甲基)苯氧基]-9-[[5-(三氟甲基)-2-吡啶基]氧基]-9-氮杂双环[3.3.1]壬烷(由WO 2011/105506 A1、WO 2016/133011 A1获知)(CAS 1332838-17-1)。

[0315] 可与式(I)的化合物和包含其的组合物混合的安全剂的实例为,例如,解草嗪(benoxacor)、解毒啶(cloquintocet(-mexyl))、解草胺腈(cyometrinil)、环丙磺酰胺(cyprosulfamide)、二氯丙烯胺(dichlormid)、解草唑(fenclorazole(-ethyl))、解草啶(fenclorim)、解草胺(flurazole)、氟草肟(fluxofenim)、解草噁唑(furilazole)、双苯噁唑酸(isoxadifen(-ethyl))、吡唑解草酯(mefenpyr(-diethyl))、萘二甲酸酐(naphthalic anhydride)、解草腈(oxabetrinil)、2-甲氧基-N-({4-[(甲基氨基甲酰基)氨基]苯基}磺酰基)苯甲酰胺(CAS 129531-12-0)、4-(二氯乙酰基)-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷(CAS 71526-07-3)、2,2,5-三甲基-3-(二氯乙酰基)-1,3-噁唑烷(CAS 52836-31-4)。

[0316] 可与式(I)的化合物和包含其的组合物混合的除草剂的实例为:

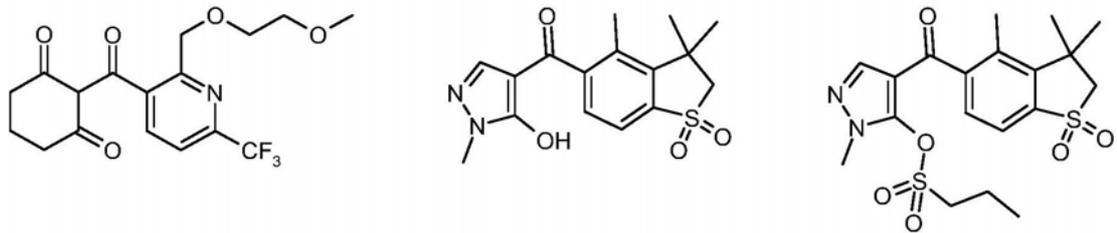
[0317] 乙草胺(acetochlor)、三氟羧草醚(acifluorfen、acifluorfen-sodium)、苯草醚(aclonifen)、甲草胺(alachlor)、二丙烯草胺(allidochlor)、枯杀达(alloxydim、

alloydim-sodium)、莠灭净 (ametryn)、氨基草酮 (amicarbazone)、先甲草胺 (amidochlor)、酰胺磺隆 (amidosulfuron)、4-氨基-3-氯-6-(4-氯-2-氟-3-甲基苯基)-5-氟吡啶-2-甲酸、氯丙嘧啶酸 (aminocyclopyrachlor)、aminocyclopyrachlor-potassium、aminocyclopyrachlor-methyl、氯氨吡啶酸 (aminopyralid)、杀草强 (amitrole)、氨基磺酸铵 (ammoniumsulfamate)、莎稗磷 (anilofos)、磺草灵 (asulam)、莠去津 (atrazine)、唑啶草酮 (azafenidin)、四唑嘧磺隆 (azimsulfuron)、氟丁酰草胺 (beflubutamid)、草除灵 (benazolin、benazolin-ethyl)、乙丁氟灵 (benfluralin)、呋草黄 (benfuresate)、苄嘧磺隆 (bensulfuron、bensulfuron-methyl)、地散磷 (bensulide)、灭草松 (bentazone)、双环磺草酮 (benzobicyclon)、吡草酮 (benzofenap)、氟吡草酮 (bicyclopyron)、甲羧除草醚 (bifenox)、双丙氨膦 (bilanafos、bilanafos-sodium)、双草醚 (bispyribac、bispyribac-sodium)、除草定 (bromacil)、溴丁酰草胺 (bromobutide)、溴酚污 (bromofenoxim)、溴苯腈 (bromoxynil)、丁酰溴苯腈 (bromoxynil-butyrate)、溴苯腈钾 (bromoxynil-potassium)、庚酰溴苯腈 (bromoxynil-heptanoate) 和辛酰溴苯腈 (bromoxynil-octanoate)、羧草酮 (busoxinone)、丁草胺 (butachlor)、氟丙嘧草酯 (butafenacil)、抑草磷 (butamifos)、丁烯草胺 (butenachlor)、仲丁灵 (butralin)、丁苯草酮 (butroxydim)、丁草敌 (butylate)、唑草胺 (cafenstrole)、双酰草胺 (carbetamide)、氟唑草酮 (carfentrazone、carfentrazone-ethyl)、草灭畏 (chloramben)、氯溴隆 (chlorbromuron)、伐草克 (chlorfenac、chlorfenac-sodium)、燕麦酯 (chlorfenprop)、甲基氯苄素 (chlorflurenol、chlorflurenol-methyl)、氯草敏 (chloridazon)、氯嘧磺隆 (chlorimuron、chlorimuron-ethyl)、chlorophthalim、绿麦隆 (chlorotoluron)、氯酞酸甲酯 (chlorthal-dimethyl)、氯磺隆 (chlorsulfuron)、吡啶酮草酯 (cinidon、cinidon-ethyl)、环庚草醚 (cinmethylin)、醚磺隆 (cinosulfuron)、氯酰草膦 (clacyfos)、烯草酮 (clethodim)、炔草酸 (clodinafop)、炔草酯 (clodinafop-propargyl)、异噁草松 (clomazone)、氯甲酰草胺 (clomeprop)、二氯吡啶酸 (clopyralid)、氯酯磺草胺 (cloransulam、cloransulam-methyl)、苄草隆 (cumyluron)、氨基氰 (cyanamide)、氰草津 (cyanazine)、环草敌 (cycloate)、cyclopyrimorate、环丙嘧磺隆 (cyclosulfamuron)、噻草酮 (cycloxydim)、氰氟草酯 (cyhalofop、cyhalofop-butyl)、环草津 (cyprazine)、2,4-D、2,4-D-丁氧基乙酯 (2,4-D-butotyl)、2,4-D-丁酯 (2,4-D-butyl)、2,4-D-二甲基铵 (2,4-D-dimethylammonium)、2,4-D-二乙醇胺 (2,4-D-diolamin)、2,4-D-乙酯 (2,4-D-ethyl)、2-乙基己酯 (2-ethylhexyl)、2,4-D-异丁酯、2,4-D-异辛酯、2,4-D-异丙基铵、2,4-D-钾、2,4-D-三异丙醇铵和2,4-D-三乙醇胺、2,4-DB、2,4-DB-丁酯、2,4-DB-二甲基铵、2,4-DB-异辛酯、2,4-DB-钾和2,4-DB-钠、杀草隆 (daimuron (dymron))、茅草枯 (dalapon)、棉隆 (dazomet)、正癸醇、甜菜安 (desmedipham)、detosyl-pyrazolate (DTP)、麦草畏 (dicamba)、敌草腈 (dichlobenil)、2-(2,4-二氯苄基)-4,4-二甲基-1,2-噁唑烷-3-酮、2-(2,5-二氯苄基)-4,4-二甲基-1,2-噁唑烷-3-酮、2,4-滴丙酸 (dichlorprop)、精2,4-滴丙酸 (dichlorprop-P)、禾草灵 (diclofop、diclofop-methyl)、diclofop-P-methyl、双氯磺草胺 (diclosulam)、野燕枯 (difenzoquat)、吡氟酰草胺 (diflufenican)、二氟吡隆 (diflufenzopyr、diflufenzopyr-sodium)、噁唑隆 (dimefuron)、哌草丹 (dimepiperate)、二甲草胺 (dimethachlor)、异戊乙净 (dimethametryn)、二甲吩草胺 (dimethenamid)、精二甲吩草胺 (dimethenamid-P)、

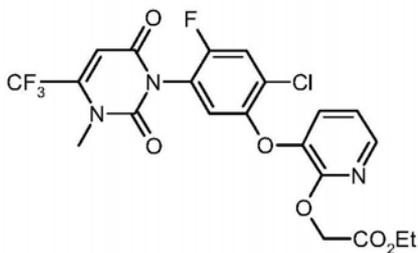
dimetrasulfuron、氨基灵(dinitramine)、特乐酚(dinoterb)、双苯酰草胺(diphenamid)、敌草快(diquat)、diquat-dibromid、氟硫草定(dithiopyr)、敌草隆(diuron)、DNOC、茵多酸(endothal)、EPTC、戊草丹(esprocarb)、乙丁烯氟灵(ethalfluralin)、胺苯磺隆(ethametsulfuron、ethametsulfuron-methyl)、乙噁草酮(ethiozin)、乙氧呋草黄(ethofumesate)、氟乳醚(ethoxyfen、ethoxyfen-ethyl)、乙氧嘧磺隆(ethoxysulfuron)、乙氧苯草胺(etobenzanid)、F-9600、F-5231(即N-{2-氯-4-氟-5-[4-(3-氟丙基)-5-氧代-4,5-二氢-1H-四唑-1-基]苯基}乙基磺酰胺)、F-7967(即3-[7-氯-5-氟-2-(三氟甲基)-1H-苯并咪唑-4-基]-1-甲基-6-(三氟甲基)嘧啶-2,4(1H,3H)-二酮)、噁唑禾草灵(fenoxaprop)、精噁唑禾草灵(fenoxaprop-P)、噁唑禾草灵(fenoxaprop-ethyl)、精噁唑禾草灵(fenoxaprop-P-ethyl)、fenoxasulfone、fenquinotrione、四唑酰草胺(fentrazamide)、麦草伏(flamprop)、高效麦草氟异丙酯(flamprop-M-isopropyl)、高效麦草氟甲酯(flamprop-M-methyl)、啶嘧磺隆(flazasulfuron)、双氟磺草胺(florasulam)、吡氟禾草灵(fluzifop)、精吡氟禾草灵(fluzifop-P)、吡氟禾草灵丁酯(fluzifop-butyl)、精吡氟禾草灵丁酯(fluzifop-P-butyl)、氟酮磺隆(flucarbazone、flucarbazone-sodium)、氟吡磺隆(flucetosulfuron)、氯乙氟灵(fluchloralin)、氟噁草胺(flufenacet)、氟吡啶草酯(flufenpyr、flufenpyr-ethyl)、唑嘧磺草胺(flumetsulam)、氟烯草酸(flumiclorac、flumiclorac-pentyl)、丙炔氟草胺(flumioxazin)、氟草隆(fluometuron)、9-羟基笏甲酸(flurenol)、笏丁酯(flurenol-butyl)、flurenol-dimethylammonium和笏醇甲酯(flurenol-methyl)、乙羧氟草醚(fluroglycofen、fluroglycofen-ethyl)、四氟丙酸(flupropanate)、氟啶嘧磺隆(flupyr-sulfuron、flupyr-sulfuron-methyl-sodium)、氟啶草酮(fluridone)、氟咯草酮(flurochloridone)、氯氟吡氧乙酸(fluroxypyr、fluroxypyr-meptyl)、呋草酮(flurtamone)、噁草酸(fluthiacet)、噁草酸甲酯(fluthiacet-methyl)、氟磺胺草醚(fomesafen)、氟磺胺草醚钠(fomesafen-sodium)、甲酰氨磺隆(foramsulfuron)、杀木膦(fosamine)、草铵膦(glufosinate)、草铵膦-铵、精草铵膦-钠(glufosinate-P-sodium)、精草铵膦-铵、精草铵膦-钠、草甘膦、草甘膦-铵、草甘膦-异丙基铵、草甘膦-二铵、草甘膦-二甲基铵、草甘膦-钾、草甘膦-钠和草硫膦(glyphosate-trimesium)、H-9201(即0-(2,4-二甲基-6-硝基苯基)0-乙基异丙基硫代磷酰胺酯(0-(2,4-dimethyl-6-nitrophenyl)0-ethyl isopropylphosphoramidothioate)、氟氯吡啶酯(haloxifen、haloxifen-methyl)、氟硝磺酰胺(halosafen)、氯吡嘧磺隆(halosulfuron、halosulfuron-methyl)、氟吡禾灵(haloxypop)、精氟吡禾灵(haloxypop-P)、氟吡禾灵乙氧基乙酯、精氟吡禾灵乙氧基乙酯、氟吡禾灵甲酯、精氟吡禾灵甲酯、环噁酮(hexazinone)、HW-02(即(2,4-二氯苯氧基)乙酸1-(二甲氧基磷酰基)乙酯)、咪草酸(imazamethabenz、imazamethabenz-methyl)、甲氧咪草烟(imazamox)、甲氧咪草烟-铵、甲咪唑烟酸(imazapic)、甲咪唑烟酸-铵、咪唑烟酸(imazapyr)、咪唑烟酸-异丙铵、咪唑喹啉酸(imazaquin)、咪唑喹啉-铵、咪唑乙烟酸(imazethapyr)、咪唑乙烟酸亚铵(imazethapyr-immonium)、唑吡嘧磺隆(imazosulfuron)、茚草酮(indanofan)、三噁茚草胺(indaziflam)、碘甲磺隆(iodosulfuron)、甲基碘磺隆钠盐(iodosulfuron-methyl-sodium)、碘苯腈(ioxynil)、辛酰碘苯腈(ioxynil-octanoate)、碘苯腈-钾和碘苯腈-钠、ipfencarbazone、异丙隆(isoproturon)、异噁隆

(isouron)、异噁酰草胺(isoxaben)、异噁唑草酮(isoxaflutole)、特胺灵(karbutilate)、KUH-043(即3-({[5-(二氟甲基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-基]甲基}磺酰基)-5,5-二甲基-4,5-二氢-1,2-噁唑)、ketospiradox、乳氟禾草灵(lactofen)、环草定(lenacil)、利谷隆(linuron)、MCPA、MCPA-丁氧基乙酯(MCPA-butotyl)、MCPA-二甲基铵、MCPA-2-乙基己酯、MCPA-异丙基铵、MCPA-钾和MCPA-钠、MCPB、MCPB-甲酯、MCPB-乙酯和MCPB-钠、2-甲-4-氯丙酸(mecoprop)、2-甲-4-氯丙酸钠和2-甲-4-氯丙酸丁氧基乙酯、精2-甲-4-氯丙酸(mecoprop-P)、精2-甲-4-氯丙酸丁氧基乙酯、精2-甲-4-氯丙酸-二甲基铵、精2-甲-4-氯丙酸-二乙基己酯和精2-甲-4-氯丙酸-钾、苯噻酰草胺(mefenacet)、氟磺酰草胺(mefluidide)、甲基二磺隆(mesosulfurone、mesosulfuron-methyl)、甲基磺草酮(mesotrione)、甲基苯噻隆(methabenzthiazuron)、威百亩(metam)、噁唑酰草胺(metamifop)、苯嗪草酮(metamitron)、吡唑草胺(metazachlor)、嗪吡嘧磺隆(metazosulfuron)、甲基苯噻隆(methabenzthiazuron)、甲硫嘧磺隆(methiopyrsulfuron)、methiozolin、异硫氰酸甲酯(methyl isothiocyanate)、溴谷隆(metobromuron)、异丙甲草胺(metolachlor)、精异丙甲草胺(S-metolachlor)、磺草唑胺(metosulam)、甲氧隆(metoxuron)、嗪草酮(metribuzin)、甲磺隆(metsulfuron、metsulfuron-methyl)、禾草敌(molinat)、绿谷隆(monolinuron)、单嘧磺隆(monosulfuron)、单嘧磺酯(monosulfuron-ester)、MT-5950(即N-(3-氯-4-异丙基苯基)-2-甲基戊酰胺)、NGGC-011、敌草胺(napropamide)、NC-310(即[5-(苄氧基)-1-甲基-1H-吡唑-4-基](2,4-二氯苯基)甲酮)、草不隆(neburon)、烟嘧磺隆(nicosulfuron)、壬酸(pelargonic acid)、氟草敏(norflurazon)、油酸(脂肪酸)、坪草丹(orbencarb)、嘧苯胺磺隆(orthosulfamuron)、氨磺乐灵(oryzalin)、丙炔噁草酮(oxadiargyl)、噁草酮(oxadiazon)、环氧嘧磺隆(oxasulfuron)、噁嗪草酮(oxaziclomefon)、乙氧氟草醚(oxyfluorfen)、百草枯(paraquat、paraquat dichloride)、克草猛(pebulate)、二甲戊灵(pendimethalin)、penoxsulam、五氯苯酚(pentachlorophenol)、环戊噁草酮(pentoxazone)、烯草胺(pethoxamid)、石油油料(petroleum oils)、甜菜宁(phenmedipham)、氨基吡啶酸(picloram)、氟吡酰草胺(picolinafen)、唑啉草酯(pinoxaden)、哌草磷(piperophos)、丙草胺(pretilachlor)、氟嘧磺隆(primisulfuron、primisulfuron-methyl)、氨氟乐灵(prodiamine)、环苯草酮(profoxydim)、扑灭通(prometon)、扑草净(prometryn)、毒草胺(propachlor)、敌稗(propamil)、噁草酸(propaquizafop)、扑灭津(propazine)、苯胺灵(propham)、异丙草胺(propisochlor)、丙苯磺隆(propoxycarbazone、propoxycarbazone-sodium)、propyrisulfuron、炔苯酰草胺(propyzamide)、苄草丹(prosulfocarb)、氟磺隆(prosulfuron)、双唑草腈(pyraclonil)、吡草醚(pyraflufen、pyraflufen-ethyl)、磺酰草吡唑(pyrasulfotole)、吡唑特(pyrazolynate(pyrazolate))、吡嘧磺隆(pyrazosulfuron、pyrazosulfuron-ethyl)、苄草唑(pyrazoxyfen)、pyribambenz、异丙酯草醚(pyribambenz-isopropyl)、丙酯草醚(pyribambenz-propyl)、嘧啶肟草醚(pyribenzoxim)、稗草丹(pyributicarb)、pyridafol、哒草特(pyridate)、环酯草醚(pyriftalide)、嘧草醚(pyriminobac、pyriminobac-methyl)、pyrimisulfan、嘧草硫醚(pyriothiobac、pyriothiobac-sodium)、pyroxasulfone、甲氧磺草胺(pyroxulam)、二氯喹啉酸(quinclorac)、氯甲喹啉酸(quinmerac)、灭藻醌

(quinoclamine)、啶禾灵(quizalofop)、啶禾灵乙酯(quizalofop-ethyl)、精啶禾灵(quizalofop-P)、精啶禾灵乙酯(quizalofop-P-ethyl)、啶禾糠酯(quizalofop-P-tefuryl)、砒嘧磺隆(rimsulfuron)、苯嘧磺草胺(saflufenacil)、烯禾啉(sethoxydim)、环草隆(siduron)、西玛津(simazine)、西草净(simetryn)、SL-261、磺草酮(sulcotrion)、甲磺草胺(sulfentrazone)、甲嘧磺隆(sulfometuron、sulfometuron-methyl)、磺酰磺隆(sulfosulfuron)、SYN-523、SYP-249 (即1-乙氧基-3-甲基-1-氧代丁-3-烯-2-基5-[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]-2-硝基苯甲酸酯)、SYP-300(即1-[7-氟-3-氧代-4-(丙-2-炔-1-基)-3,4-二氢-2H-1,4-苯并噁嗪-6-基]-3-丙基-2-硫代咪唑烷-4,5-二酮)、2,3,6-TBA、TCA(三氯乙酸)、三氟乙酸钠、丁噻隆(tebuthiuron)、呋喃磺草酮(tefuryltrione)、环磺酮(tembotrione)、吡喃草酮(tepraloxymid)、特草定(terbacil)、特草灵(terbucarb)、特丁通(terbumeton)、特丁津(terbuthylazine)、特丁净(terbutryn)、噻吩草胺(thenylchlor)、噻唑烟酸(thiazopyr)、噻酮磺隆(thiencarbazone、thiencarbazone-methyl)、噻吩磺隆(thifensulfuron、thifensulfuron-methyl)、禾草丹(thiobencarb)、tiafenacil、tolpyralate、苯吡唑草酮(topramezone)、三甲苯草酮(tralkoxydim)、triafamone、野燕畏(tri-allylate)、醚苯磺隆(triasulfuron)、三嗪氟草胺(triaziflam)、苯磺隆(tribenuron、tribenuron-methyl)、三氯吡氧乙酸(triclopyr)、草达津(trietazine)、三氟啉磺隆(trifloxysulfuron、trifloxysulfuron-sodium)、trifludimoxazin、氟乐灵(trifluralin)、氟胺磺隆(triflusulfuron、triflusulfuron-methyl)、三氟甲磺隆(tritosulfuron)、硫酸脲、灭草敌(vernolate)、XDE-848、ZJ-0862(即3,4-二氯-N-{2-[4,6-二甲氧基嘧啶-2-基]氧基}苄基)苯胺),以及以下化合物:



[0318]



[0319] 植物生长调节剂的实例为:

[0320] 活化酯(Acibenzolar)、苯并噻二唑(acibenzolar-S-methyl)、5-氨基乙酰丙酸(5-aminolevulinic acid)、嘧啶醇(ancymidol)、6-苄基氨基嘌呤、芸苔素内酯(Brassinolid)、儿茶素(catechine)、矮壮素(chlormequat chloride)、调果酸(cloprop)、环丙酰胺酸(cyclanilide)、3-(环丙-1-烯基)丙酸、丁酰肼(daminozide)、棉隆、正癸醇、调味酸(dikegulac)、敌草克钠(dikegulac-sodium)、茵多酸(endothal)、茵多酸-二钾(endothal-dipotassium)、茵多酸-二钠(endothal-disodium)和茵多酸-单(N,N-二甲烷基铵)、乙烯利(ethephon)、氟节胺(flumetralin)、9-羟基笏甲酸、笏丁酯、呋啶醇

(flurprimidol)、氯吡脞 (forchlorfenuron)、赤霉酸 (gibberellic acid)、抗倒胺 (inabenfide)、吲哚-3-乙酸 (IAA)、4-吲哚-3-基丁酸、稻瘟灵 (isoprothiolane)、烯丙苯噻唑 (probenazole)、茉莉酸 (jasmonic acid)、马来酰肼、助壮素 (mepiquat chloride)、1-甲基环丙烯、茉莉酸甲酯、2-(1-萘基)乙酰胺、1-萘乙酸、2-萘氧基乙酸、硝基酚盐混合物 (nitrophenoxide mixture)、多效唑 (paclobutrazol)、N-(2-苯乙基)- $\beta$ -丙氨酸、N-苯基邻苯二甲酸、调环酸 (prohexadione)、调环酸-钙 (prohexadione-calcium)、茉莉酮 (prohydrojasmon)、水杨酸、独角金内酯 (strigolactone)、四氧硝基苯 (tecnazene)、噻苯隆 (thidiazuron)、三十烷醇 (triacontanol)、抗倒酯 (trinexapac, trinexapac-ethyl)、tsitodef、烯效唑 (uniconazole)、精烯效唑 (uniconazole-P)。

#### [0321] 方法和用途

[0322] 式(I)的化合物和包含其的组合物具有有效的杀微生物活性和/或植物防御调节潜力。可将它们用于防治不想要的微生物,例如不想要的真菌、卵菌和细菌。它们在作物保护(它们防治引起植物病害的微生物)中或对于保护材料(例如,工业材料、木材、贮存物)是特别有用的,如下文更详细地说明的那样。更具体地,式(I)的化合物和包含其的组合物可被用于保护种子、发芽的种子、出土的幼苗、植物、植物部位、果实、收获的产物和/或植物生长的土壤免受不想要的微生物的侵袭。

[0323] 如文中使用的防治或防治(control or controlling)包括不想要的微生物的保护性处理、治疗性处理和根除性处理。不想要的微生物可以是致病细菌、致病病毒、致病卵菌或致病真菌,更具体地是植物病原性细菌、植物病原性病毒、植物病原性卵菌或植物病原性真菌。如下文中所详述的,这些植物病原性微生物是广谱的植物病害的病原体。

[0324] 更具体地,可将式(I)的化合物和包含其的组合物用作杀真菌剂。为本发明的目的,术语“杀真菌剂”是指可在作物保护中用于防治不想要的真菌和/或用于防治卵菌纲(Oomycetes)的化合物或组合物,所述真菌如根肿菌纲(Plasmodiophoromycetes)、壶菌纲(Chytridiomycetes)、接合菌纲(Zygomycetes)、子囊菌纲(Ascomycetes)、担子菌纲(Basidiomycetes)和半知菌纲(Deuteromycetes)。

[0325] 还可将式(I)的化合物和包含其的组合物用作抗菌剂。特别地,它们可在作物保护中使用,例如用于防治不想要的细菌,例如假单胞菌科(Pseudomonadaceae)、根瘤菌科(Rhizobiaceae)、黄单胞菌科(Xanthomonadaceae)、肠杆菌科(Enterobacteriaceae)、棒状杆菌科(Corynebacteriaceae)和链霉菌科(Streptomyetaceae)。

[0326] 式(I)的化合物和包含其的组合物也可在作物保护中用作抗病毒剂。例如,式(I)的化合物和包含其的组合物可以对以下植物病毒的病害具有功效:例如烟草花叶病毒(TMV)、烟草脆裂病毒、烟草矮化病毒(TStuV)、烟草曲叶病毒(VLCV)、烟草脉带花叶病毒(TVBMV)、烟草坏死矮缩病毒(TNDV)、烟草线条病毒(TSV)、马铃薯X病毒(PVX)、马铃薯Y病毒、马铃薯S病毒、马铃薯M病毒和马铃薯A病毒、马铃薯奥古巴花叶病毒(PAMV)、马铃薯帚顶病毒(PMTV)、马铃薯卷叶病毒(PLRV)、苜蓿花叶病毒(AMV)、黄瓜花叶病毒(CMV)、黄瓜绿斑驳花叶病毒(CGMMV)、黄瓜黄化病毒(CuYV)、西瓜花叶病毒(WMV)、番茄斑萎病毒(TSWV)、番茄环斑病毒(TomRSV)、甘蔗花叶病毒(SCMV)、水稻矮缩病毒、水稻条叶枯病毒、水稻黑条矮缩病毒、草莓斑驳病毒(SMoV)、草莓镶脉病毒(SVBV)、草莓轻型黄边病毒(SMYEV)、草莓皱缩病毒(SCrV)、蚕豆萎蔫病毒(BBwV)和甜瓜坏死斑点病毒(MNSV)。

[0327] 本发明还涉及一种防治不想要的植物病原性微生物如不想要的真菌、卵菌和细菌的方法,包括将至少一种式(I)的化合物或至少一种包含其的组合物施用至植物、植物部位、种子、果实或植物生长的土壤的步骤。

[0328] 通常,当式(I)的化合物和包含其的组合物在用于防治植物病原性真菌和/或植物病原性卵菌的治疗性方法或保护性方法中使用时,将其有效且植物-相容的量施用至植物、植物部位、果实、种子或施用至植物生长的土壤或基质。可用于培育植物的合适的基质包括基于无机物的基质,例如矿物棉,特别是岩棉、珍珠岩、沙或砂砾;有机基质,例如泥煤、松树皮或锯屑;以及基于石油的基质如聚合物泡沫或塑料珠。有效且植物-相容的量意指足以防治或破坏农田上存在的或易于出现的真菌,并且不会引起所述作物的任何明显的植物毒性症状的量。根据待防治的真菌、作物的类型、作物生长阶段、气候条件和使用的式(I)的各化合物或组合物,这样的量可在宽范围内变化。该量可通过本领域技术人员能力范围内的系统性田间试验确定。

[0329] 植物和植物部位

[0330] 可将式(I)的化合物和包含其的组合物施用于任何植物或植物部位。

[0331] 植物意指所有的植物和植物种群,例如需要和不需要的野生植物或作物植物(包括天然存在的作物植物)。作物植物可为可通过常规育种和优化方法或通过生物技术和基因工程方法或这些方法的组合而获得的植物,包括遗传修饰植物(GMO或转基因植物)以及可受植物育种者权保护和不受植物育种者权保护的植物栽培种。

[0332] 遗传修饰植物(GMO)

[0333] 遗传修饰植物(GMO或转基因植物)是异源基因已被稳定地整合到基因组中的植物。表述“异源基因”主要意指在植物体外提供或组装的基因,并且当其被引入至细胞核、叶绿体或线粒体的基因组中时,该基因通过表达目的蛋白或多肽或通过下调或使其他存在于植物中的基因沉默(利用例如反义技术、共抑制技术、RNA干扰-RNAi-技术或 microRNA-miRNA-技术)而赋予转化的植物新的或改进的农学特性或其他特性。位于基因组中的异源基因也称为转基因。由其在植物基因组中的特定位置限定的转基因被称为转化株系或转基因株系。

[0334] 植物栽培种理解为意指具有新特性(“性状”)且已通过常规育种、诱变或重组DNA技术获得的植物。它们可为栽培种、变种、生物型或基因型。

[0335] 植物部位理解为意指植物的所有地上和地下部位和器官,例如芽、叶、针叶、茎、干、花、子实体、果实、种子、根、球茎和根状茎。植物部位也包括采收材料和无性繁殖和有性繁殖材料,例如插条、块茎、根状茎、分蘖(slips)和种子。

[0336] 可根据本文中记载的方法处理的植物包括以下植物:棉花、亚麻、葡萄树、果树、蔬菜,如蔷薇科属(Rosaceae sp.) (例如仁果,例如苹果和梨,以及核果,例如杏、樱桃、扁桃和桃,和软果,例如草莓)、茶藨子科属(Ribesioideae sp.)、胡桃科属(Juglandaceae sp.)、桦木科属(Betulaceae sp.)、漆树科属(Anacardiaceae sp.)、壳斗科属(Fagaceae sp.)、桑科属(Moraceae sp.)、木犀科属(Oleaceae sp.)、猕猴桃科属(Actinidaceae sp.)、樟科属(Lauraceae sp.)、芭蕉科属(Musaceae sp.) (例如香蕉树和绿化树(plantations))、茜草科属(Rubiaceae sp.) (例如咖啡)、山茶科属(Theaceae sp.)、梧桐科属(Sterculiaceae sp.)、芸香科属(Rutaceae sp.) (例如柠檬、橙子和葡萄柚)、茄科属(Solanaceae sp.) (例

如西红柿)、百合科属(Liliaceae sp.)、菊科属(Asteraceae sp.) (例如莴苣)、伞形科属(Umbelliferae sp.)、十字花科属(Cruciferae sp.)、藜科属(Chenopodiaceae sp.)、葫芦科属(Cucurbitaceae sp.) (例如黄瓜)、葱科属(Alliaceae sp.) (例如韭菜、洋葱)、蝶形花科属(Papilionaceae sp.) (例如豌豆);主要的作物植物,例如禾本科属(Gramineae sp.) (例如玉米、草皮草(turf),谷类如小麦、黑麦、水稻、大麦、燕麦、粟和黑小麦)、菊科属(Asteraceae sp.) (例如向日葵)、十字花科属(Brassicaceae sp.) (例如白球甘蓝、红球甘蓝、椰菜、花椰菜、孢子甘蓝、小白菜、球茎甘蓝、萝卜和油菜、芥菜、辣根和水芹)、豆科属(Fabaceae sp.) (例如豆、花生)、蝶形花科属(Papilionaceae sp.) (例如大豆)、茄科属(Solanaceae sp.) (例如马铃薯)、藜科属(Chenopodiaceae sp.) (例如糖用甜菜、饲用甜菜、叶甜菜(swiss chard)、甜菜根);用于园艺和森林区域的有用植物和观赏植物;以及这些植物各自的遗传修饰品种。

[0337] 可通过上述公开方法处理的植物和植物栽培种包括对一种或多种生物胁迫具有耐受性的植物和植物栽培种,即,所述植物对动物和微生物害虫(例如对线虫、昆虫、螨、植物病原性真菌、细菌、病毒和/或类病毒)表现出更好的抵抗力。

[0338] 可通过上述公开方法处理的植物和植物栽培种包括对一种或多种非生物胁迫具有抗性的那些植物。非生物胁迫条件可包括例如干旱、低温暴露、热暴露、渗透胁迫、水涝、提高的土壤含盐度、增强的矿物暴露、臭氧暴露、强光暴露、有限的氮营养素利用度、有限的磷营养素利用度、避荫。

[0339] 可通过上述公开方法处理的植物和植物栽培种包括那些以提高的产量特性为特征的植物。所述植物中提高的产量可以是以下因素的结果:例如,改良的植物生理机能、生长和发育,例如水利用效率、保水效率、改善的氮利用、增强的碳同化作用、改善的光合作用、提高的发芽率和加速成熟。此外,产量还受改进的植物构造的影响(在胁迫和非胁迫条件下),包括但不限于:提早开花、对杂交种子生产的开花控制、秧苗活力、植株大小、节间数和节间距、根系生长、种子大小、果实大小、荚果大小、荚果数或穗数、每个荚果或穗的种子数量、种子质量、增强的种子饱满度、减少的种子分散、减少的荚果开裂以及抗倒伏。其他的产量特征包括种子组成,如碳水化合物含量和组成,例如棉或淀粉、蛋白质含量、油含量和组成、营养价值、抗营养化合物的降低、改善的加工性和更好的贮存稳定性。

[0340] 可通过上述公开方法处理的植物和植物栽培种包括为已经表现出杂种优势或杂种活力的特性的杂种植物的植物和植物栽培种,所述特性通常会导致更高的产量、活力、健康度和对生物和非生物胁迫的抗性。

[0341] 可通过上述公开方法处理的植物和植物栽培种(通过植物生物技术方法如基因工程获得)包括为除草剂-耐受性植物的植物和植物栽培种,即,对一种或多种给定的除草剂具有耐受性的植物。这类植物可以通过遗传转化或通过选择含有赋予所述除草剂耐受性的突变的植物获得。

[0342] 可通过上述公开方法处理的植物和植物栽培种(通过植物生物技术方法如基因工程获得)包括为昆虫-抗性的转基因植物的植物和植物栽培种,即,对某些目标昆虫的攻击具有抗性的植物。这类植物可通过遗传转化或通过选择含有赋予所述昆虫抗性的突变的植物获得。

[0343] 可通过上述公开方法处理的植物和植物栽培种(通过植物生物技术方法如基因工

程获得)包括为抗病转基因植物的植物和植物栽培种,即,对某些目标昆虫的攻击具有抗性的植物。这类植物可通过遗传转化或通过选择含有赋予所述昆虫抗性的突变的植物获得。

[0344] 可通过上述公开方法处理的植物和植物栽培种(通过植物生物技术方法如基因工程获得)包括对非生物胁迫具有耐受性的植物和植物栽培种。这类植物可通过遗传转化或通过选择含有赋予所述胁迫耐受性的突变的植物获得。

[0345] 可通过上述公开方法处理的植物和植物栽培种(通过植物生物技术方法如基因工程获得)包括显示出改变的采收产物的数量、质量和/或贮存稳定性和/或改变的采收产物的具体成分的性质的植物和植物栽培种。

[0346] 可通过上述公开方法处理的植物和植物栽培种(通过植物生物技术方法如基因工程获得)包括具有改变的纤维特性的植物和植物栽培种,例如棉花植物。这类植物可通过遗传转化或通过选择含有赋予所述改变的纤维特性的突变的植物获得。

[0347] 可通过上述公开方法处理的植物和植物栽培种(通过植物生物技术方法如基因工程获得)包括具有改变的油分布特性的植物和植物栽培种,例如油菜或相关的芸苔属(*Brassica*)植物。这类植物可通过遗传转化或通过选择含有赋予所述改变的油分布特性的突变的植物获得。

[0348] 可通过上述公开方法处理的植物和植物栽培种(通过植物生物技术方法如基因工程获得)包括具有改变的落粒(*seed shattering*)特性的植物和植物栽培种,例如油菜或相关的芸苔属植株。这类植物可通过遗传转化或通过选择含有赋予所述改变的落粒特性的突变的植物获得,并且这类植物包括具有延迟或降低的落粒特性的植物,例如油菜植物。

[0349] 可通过上述公开方法处理的植物和植物栽培种(通过植物生物技术方法如基因工程获得)包括具有改变的翻译后蛋白修饰模式的植物和植物栽培种,例如烟草植物。

[0350] 病原体

[0351] 可根据本发明处理的病害的病原体的非限制实例包括:

[0352] 由白粉病病原体引起的病害,例如白粉菌(*Blumeria*)属种,例如小麦白粉菌(*Blumeria graminis*);叉丝单囊壳(*Podosphaera*)属种,例如白叉丝单囊壳(*Podosphaera leucotricha*);单囊壳(*Sphaerotheca*)属种,例如凤仙花单囊壳(*Sphaerotheca fuliginea*);钩丝壳(*Uncinula*)属种,例如葡萄钩丝壳(*Uncinula necator*);

[0353] 由锈病病原体引起的病害,例如胶锈菌(*Gymnosporangium*)属种,例如褐色胶锈菌(*Gymnosporangium sabinae*);驼孢锈(*Hemileia*)属种,例如咖啡驼孢锈菌(*Hemileia vastatrix*);层锈菌(*Phakopsora*)属种,例如豆薯层锈菌(*Phakopsora pachyrhizi*)或山马蝗层锈菌(*Phakopsora meibomia*);柄锈菌(*Puccinia*)属种,例如隐匿柄锈菌(*Puccinia recondita*)、禾柄锈菌(*Puccinia graminis*)或条形柄锈菌(*Puccinia striiformis*);单胞锈菌(*Uromyces*)属种,例如疣顶单胞锈菌(*Uromyces appendiculatus*);

[0354] 由卵菌纲(*Oomycetes*)病原体引起的病害,例如,白锈菌(*Albugo*)属种,例如菜白锈菌(*Albugo candida*);盘霜霉(*Bremia*)属种,例如莴苣盘霜霉(*Bremia lactucae*);霜霉(*Peronospora*)属种,例如豌豆霜霉(*Peronospora pisi*)或十字花科霜霉(*P.brassicae*);疫霉(*Phytophthora*)属种,例如致病疫霉(*Phytophthora infestans*);轴霜霉(*Plasmopara*)属种,例如葡萄轴霜霉(*Plasmopara viticola*);假霜霉

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

[0355] 由以下病原体引起的叶斑枯病 (leaf blotch) 和叶萎蔫病 (leaf wilt) 病害: 例如, 链格孢 (*Alternaria*) 属种, 例如早疫病链格孢 (*Alternaria solani*); 尾孢 (*Cercospora*) 属种, 例如蒺菜生尾孢 (*Cercospora beticola*); 枝孢 (*Cladosporium*) 属种, 例如黄瓜枝孢 (*Cladosporium cucumerinum*); 旋孢腔菌 (*Cochliobolus*) 属种, 例如禾旋孢腔菌 (*Cochliobolus sativus*) (分生孢子形式: 内脐蠕孢属 (*Drechslera*), 同义词: 长蠕孢菌 (*Helminthosporium*)) 或宫部旋孢腔菌 (*Cochliobolus miyabeanus*); 炭疽菌 (*Colletotrichum*) 属种, 例如菜豆炭疽菌 (*Colletotrichum lindemuthanium*); 棒孢菌 (*Corynespora*) 属种, 例如山扁豆生棒孢 (*Corynespora cassiicola*); 锈斑病菌 (*Cycloconium*) 属种, 例如孔雀斑病 (*Cycloconium oleaginum*); 间座壳 (*Diaporthe*) 属种, 例如柑桔间座壳 (*Diaporthe citri*); 痂囊腔菌 (*Elsinoe*) 属种, 例如柑桔痂囊腔菌 (*Elsinoe fawcettii*); 盘长孢 (*Gloeosporium*) 属种, 例如悦色盘长孢 (*Gloeosporium laeticolor*); 小丛壳 (*Glomerella*) 属种, 例如围小丛壳 (*Glomerella cingulata*); 球座菌 (*Guignardia*) 属种, 例如葡萄球座菌 (*Guignardia bidwelli*); 小球腔菌 (*Leptosphaeria*) 属种, 例如斑污小球腔菌 (*Leptosphaeria maculans*); 大毁壳 (*Magnaporthe*) 属种, 例如灰色大毁壳 (*Magnaporthe grisea*); 微座孢属 (*Microdochium*), 例如雪霉微座孢 (*Microdochium nivale*); 球腔菌 (*Mycosphaerella*) 属种, 例如禾生球腔菌 (*Mycosphaerella graminicola*)、落花生球腔菌 (*Mycosphaerella arachidicola*) 或斐济球腔菌 (*Mycosphaerella fijiensis*); 暗球腔菌 (*Phaeosphaeria*) 属种, 例如颖枯暗球腔菌 (*Phaeosphaeria nodorum*); 核腔菌 (*Pyrenophora*) 属种, 例如圆核腔菌 (*Pyrenophora teres*) 或偃麦草核腔菌 (*Pyrenophora tritici repentis*); 柱隔孢 (*Ramularia*) 属种, 例如辛加柱隔孢 (*Ramularia collo-cygni*) 或白斑柱隔孢 (*Ramularia areola*); 喙孢 (*Rhynchosporium*) 属种, 例如黑麦喙孢 (*Rhynchosporium secalis*); 壳针孢 (*Septoria*) 属种, 例如芹菜小壳针孢 (*Septoria apii*) 或西红柿壳针孢 (*Septoria lycopersici*); 壳多胞菌 (*Stagonospora*) 属种, 例如颖枯壳多孢 (*Stagonospora nodorum*); 核瑚菌 (*Typhula*) 属种, 例如肉孢核瑚菌 (*Typhula incarnata*); 黑星菌 (*Venturia*) 属种, 例如苹果黑星病菌 (*Venturia inaequalis*);

[0356] 由以下病原体引起的根和茎的病害: 例如, 伏革菌 (*Corticium*) 属种, 例如禾伏革菌 (*Corticium graminearum*); 镰孢 (*Fusarium*) 属种, 例如尖镰孢 (*Fusarium oxysporum*); 顶囊壳 (*Gaeumannomyces*) 属种, 例如禾顶囊壳 (*Gaeumannomyces graminis*); 根肿菌属 (*Plasmodiophora*), 例如根肿病菌 (*Plasmodiophora brassicae*); 丝核菌 (*Rhizoctonia*) 属种, 例如立枯丝核菌 (*Rhizoctonia solani*); 帚枝杆孢 (*Sarocladium*) 属种, 例如稻帚枝杆孢 (*Sarocladium oryzae*); 小核菌 (*Sclerotium*) 属种, 例如稻腐小核菌 (*Sclerotium oryzae*); 塔普斯 (*Tapesia*) 属种, 例如塔普斯梭状芽孢杆菌 (*Tapesia acuformis*); 根串珠霉 (*Thielaviopsis*) 属种, 例如烟草根串珠霉 (*Thielaviopsis basicola*);

[0357] 由以下病原体引起的肉穗花序和散穗花序病害 (包括玉米穗轴): 例如, 链格孢属种, 例如链格孢属 (*Alternaria* spp.); 曲霉 (*Aspergillus*) 属种, 例如黄曲霉

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

[0358] 由黑粉菌引起的病害: 例如, 轴黑粉菌 (*Sphacelotheca*) 属种, 例如丝孢堆黑粉菌 (*Sphacelotheca reiliana*); 腥黑粉菌 (*Tilletia*) 属种, 例如小麦网腥黑粉菌 (*Tilletia caries*) 或小麦矮腥黑粉菌 (*Tilletia controversa*); 条黑粉菌 (*Urocystis*) 属种, 例如隐条黑粉菌 (*Urocystis occulta*); 黑粉菌 (*Ustilago*) 属种, 例如裸黑粉菌 (*Ustilago nuda*);

[0359] 由以下病原体引起的果实腐烂: 例如, 曲霉属种, 例如黄曲霉; 葡萄孢 (*Botrytis*) 属种, 例如灰葡萄孢 (*Botrytis cinerea*); 链核盘菌 (*Monilinia*) 属种, 例如核果链核盘菌 (*Monilinia laxa*); 青霉 (*Penicillium*) 属种, 例如扩展青霉 (*Penicillium expansum*) 或产紫青霉 (*Penicillium purpurogenum*); 根霉菌属 (*Rhizopus*), 例如匍枝根霉 (*Rhizopus stolonifer*); 核盘菌 (*Sclerotinia*) 属种, 例如核盘菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*); 轮枝菌 (*Verticillium*) 属种, 例如黑白轮枝菌 (*Verticillium alboatrum*);

[0360] 由以下病原体引起的种传的和土传的腐烂和萎蔫病害, 以及幼苗的病害: 例如, 链格孢属种, 例如芸薹链格孢 (*Alternaria brassicicola*); 丝囊霉 (*Aphanomyces*) 属种, 例如根腐丝囊霉 (*Aphanomyces euteiches*); 壳二孢 (*Ascochyta*) 属种, 例如兵豆壳二孢 (*Ascochyta lentis*); 曲霉属种, 例如黄曲霉; 枝孢属种, 例如草本枝孢 (*Cladosporium herbarum*); 旋孢腔菌属种, 例如禾旋孢腔菌 (分生孢子形式: 内脐蠕孢属, 离蠕孢属 (*Bipolaris*), 同义词: 长蠕孢菌); 炭疽菌属种, 例如毛核炭疽菌 (*Colletotrichum coccodes*); 镰孢属种, 例如黄色镰孢; 赤霉属种, 例如玉蜀黍赤霉; 壳球孢 (*Macrophomina*) 属种, 例如菜豆壳球孢 (*Macrophomina phaseolina*); 微座孢属, 例如雪霉微座孢; 小画线壳属种, 例如雪腐小画线壳; 青霉属种, 例如扩展青霉; 茎点霉 (*Phoma*) 属种, 例如黑胫茎点霉 (*Phoma lingam*); 拟茎点霉 (*Phomopsis*) 属种, 例如大豆拟茎点霉 (*Phomopsis sojae*); 疫霉属种, 例如恶疫霉 (*Phytophthora cactorum*); 核腔菌属种, 例如麦类核腔菌 (*Pyrenophora graminea*); 梨孢 (*Pyricularia*) 属种, 例如稻梨孢 (*Pyricularia oryzae*); 腐霉属种, 例如终极腐霉; 丝核菌属种, 例如立枯丝核菌; 根霉菌属种, 例如稻根霉菌 (*Rhizopus oryzae*); 小核菌属种, 例如齐整小核菌 (*Sclerotium rolfsii*); 壳针孢属种, 例如颖枯壳针孢 (*Septoria nodorum*); 核瑚菌属种, 例如肉孢核瑚菌; 轮枝孢菌 (*Verticillium*) 属种, 例如大丽花轮枝孢 (*Verticillium dahliae*);

[0361] 由以下病原体引起的癌性病害、菌瘿和扫帚病 (witches' broom): 例如, 丛赤壳 (*Nectria*) 属种, 例如仁果干癌丛赤壳菌 (*Nectria galligena*);

[0362] 由以下病原体引起的萎缩病害: 例如, 轮枝孢菌属种, 例如 (*Verticillium longisporum*); 镰孢属种, 例如尖镰孢;

[0363] 由以下病原体引起的叶、花和果实的变形: 例如, 外担菌 (*Exobasidium*) 属种, 例如坏损外担菌 (*Exobasidium vexans*); 外囊菌 (*Taphrina*) 属种, 例如桃外囊菌 (*Taphrina deformans*);

[0364] 由以下病原体引起的木本植物退行性病害:例如,依科(*Esca*)属种,例如根霉格孢菌(*Phaeomoniella chlamydospora*)、鸡腿蘑丝孢(*Phaeoacremonium aleophilum*)或地中海孢孔菌(*Fomitiporia mediterranea*);灵芝(*Ganoderma*)属种,例如狭长孢灵芝(*Ganoderma boninense*);

[0365] 由以下病原体引起的植物块茎的病害:例如,丝核菌属种,例如立枯丝核菌;长蠕孢菌属种,例如茄病长蠕孢(*Helminthosporium solani*);

[0366] 由以下细菌性病原体引起的病害:例如,黄单胞菌(*Xanthomonas*)属种,例如野油菜黄单胞菌白叶枯变种(*Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*);假单胞菌(*Pseudomonas*)属种,例如丁香假单胞菌黄瓜角斑病致病变种(*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*);欧文氏菌(*Erwinia*)属种,例如噬淀粉欧文氏菌(*Erwinia amylovora*);韧皮杆菌(*Liberibacter*)属种,例如亚洲韧皮杆菌(*Liberibacter asiaticus*);木杆菌属(*Xyella*)属种,例如苛养木杆菌(*Xylella fastidiosa*);罗尔斯通氏菌(*Ralstonia*)属种,例如青枯雷尔氏菌(*Ralstonia solanacearum*);*Dickeya*属种,例如*Dickeya solani*;棒形杆菌(*Clavibacter*)属种,例如密执安棒形杆菌(*Clavibacter michiganensis*);链霉菌属种,例如疮痂病链霉菌(*Streptomyces scabies*)。

[0367] 大豆病害:

[0368] 由以下病原体引起的叶、茎、荚和种子的真菌病害:例如,轮纹叶斑病(*Alternaria leaf spot*) (*Alternaria spec. atrans tenuissima*)、炭疽病(*Anthraco nose*) (*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*)、褐斑病(*brown spot*) (大豆壳针孢(*Septoria glycines*))、尾孢菌叶斑病和叶枯病(*cercospora leaf spot and blight*) (菊池尾孢(*Cercospora kikuchii*))、笄霉叶枯病(*choanephora leaf blight*) (漏斗笄霉(*Choanephora infundibulifera trispora* (同义词)))、疏毛核菌霉属叶斑病(*dactuliophora leaf spot*) (*Dactuliophora glycines*)、大豆霜霉病(*downy mildew*) (东北霜霉(*Peronospora manshurica*))、内脐蠕孢枯萎病(*drechslera blight*) (*Drechslera glycini*)、蛙眼叶斑病(*frogeye leaf spot*) (大豆尾孢(*Cercospora sojae*))、小光亮叶斑病(*leptosphaerulina leaf spot*) (三叶草小光亮(*Leptosphaerulina trifolii*))、叶点霉属叶斑病(*phyllosticta leaf spot*) (大豆生叶点霉(*Phyllosticta sojaecola*))、荚和茎枯萎病(大豆拟茎点霉)、白粉病(扩散叉丝壳(*Microsphaera diffusa*))、棘壳孢叶斑病(*Pyrenochaeta glycines*)、气生丝核菌(*rhizoctonia aerial*)、叶枯病和网枯病(*foliage and web blight*) (立枯丝核菌)、锈病(豆薯层锈菌、山马蝗层锈菌)、黑星病(*scab*) (大豆痂圆孢(*Sphaceloma glycines*))、匍柄霉叶枯病(匍柄霉(*Stemphylium botryosum*))、猝死综合症(*sudden death syndrome*) (大豆猝死综合症病菌(*Fusarium virguliforme*))、靶斑病(*target spot*) (山扁豆生棒孢(*Corynespora cassiicola*))。

[0369] 由以下病原体引起的根部和茎部的真菌病害:例如,黑色根腐病(野百合丽赤壳菌(*Calonectria crotalariae*))、炭腐病(菜豆生壳球孢(*Macrophomina phaseolina*))、镰孢枯萎病或萎蔫、根腐以及荚和根颈腐烂病(尖镰孢、直喙镰孢(*Fusarium orthoceras*)、半裸镰孢(*Fusarium semitectum*)、木贼镰孢(*Fusarium equiseti*))、*mycoleptodiscus*根腐病(*Mycoleptodiscus terrestris*)、新赤壳属病(*neocosmospora*) (侵菅新赤壳(*Neocosmospora vasinfecta*))、荚和茎枯萎病(*pod and stem blight*) (菜豆间座壳

(*Diaporthe phaseolorum*))、茎腐败(大豆北方茎溃疡病菌(*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*))、疫霉腐病(大雄疫霉(*Phytophthora megasperma*))、褐茎腐病(大豆茎褐腐病菌(*Phialophora gregata*))、腐霉病(*pythium rot*) (瓜果腐霉(*Pythium aphanidermatum*))、畸雌腐霉(*Pythium irregulare*)、德巴利腐霉(*Pythium debaryanum*)、群结腐霉(*Pythium myriotylum*)、终极腐霉)、丝核菌根腐病、茎腐(*stem decay*)和立枯病(立枯丝核菌)、核盘菌茎腐病(*sclerotinia stem decay*) (核盘菌)、核盘菌白绢病(*sclerotinia southern blight*) (*Sclerotinia rolfisii*)、根串珠霉根腐病(*thielaviopsis root rot*) (烟草根串珠霉)。

#### [0370] 霉菌毒素

[0371] 此外,式(I)的化合物和包含其的组合物可以降低采收材料和由其制得的食物和饲料中的霉菌毒素含量。霉菌毒素特别包括但不排除以下物质:脱氧萎镰菌醇(*deoxynivalenol*) (DON)、瓜萎镰菌醇(*nivalenol*)、15-Ac-DON、3-Ac-DON、T2-毒素和HT2-毒素、伏马菌素(*fumonisin*)、玉米赤霉烯酮(*zearalenon*)、念珠菌毒素(*moniliformin*)、镰菌素(*fusarin*)、蛇形菌素(*diacetoxyscirpenol*) (DAS)、白僵菌素(*beauvericin*)、恩镰孢菌素(*enniatin*)、层出镰孢菌素(*fusaroproliferin*)、*fusarenol*、赭曲霉毒素(*ochratoxins*)、棒曲霉毒素(*patulin*)、麦角生物碱(*ergot alkaloids*)和黄曲霉毒素(*aflatoxins*) ,这些物质可例如由以下真菌产生:镰刀菌属种(*Fusarium spec.*) ,例如锐顶镰刀菌(*F. acuminatum*)、亚洲镰孢菌(*F. asiaticum*)、燕麦镰刀菌(*F. avenaceum*)、克地镰刀菌(*F. crookwellense*)、黄色镰孢菌(*F. culmorum*)、禾谷镰刀菌(*F. graminearum*) (玉蜀黍赤霉)、水贼镰刀菌(*F. equiseti*)、水稻恶苗病菌(*F. fujikoroi*)、香蕉镰刀菌 (*F. musarum*)、尖孢镰刀菌(*F. oxysporum*)、再育镰刀菌(*F. proliferatum*)、梨孢镰刀菌(*F. poae*)、小麦冠腐病菌(*F. pseudograminearum*)、接骨木镰刀菌(*F. sambucinum*)、藤草镰刀菌(*F. scirpi*)、半裸镰刀菌(*F. semitectum*)、茄病镰刀菌(*F. solani*)、拟枝孢镰刀菌(*F. sporotrichoides*)、*F. langsethiae*、胶孢镰刀菌(*F. subglutinans*)、三线镰孢菌(*F. tricinctum*)、串珠镰刀菌(*F. verticillioides*)等;以及由曲霉属真菌属种(*Aspergillus spec.*)产生,例如黄曲霉(*A. flavus*)、寄生曲霉(*A. parasiticus*)、特异曲霉(*A. nomius*)、棕曲霉(*A. ochraceus*)、棒曲霉(*A. clavatus*)、土曲霉(*A. terreus*)、杂色曲霉(*A. versicolor*) ;青霉菌属种(*Penicillium spec.*) ,例如纯绿青霉(*P. verrucosum*)、鲜绿青霉(*P. viridicatum*)、桔青霉 (*P. citrinum*)、梨青霉(*P. expansum*)、棒形青霉(*P. claviforme*)、萎地青霉(*P. roqueforti*) ;麦角菌属种,例如紫麦角菌(*C. purpurea*)、纺锤麦角菌(*C. fusiformis*)、雀稗麦角菌(*C. paspali*)、非洲麦角菌 (*C. africana*) ;葡萄穗霉属种(*Stachybotrys spec.*)及其他。

#### [0372] 材料保护

[0373] 式(I)的化合物和包含其的组合物也可用于保护材料、尤其是用于保护工业材料抵抗植物病原性真菌的侵袭和破坏。

[0374] 此外,式(I)的化合物和包含其的组合物可单独或与其他活性成分结合用作防污组合物。

[0375] 在本发明上下文中,工业材料理解为意指为了工业应用而制备的无生命材料。例如,保护免于微生物的改变或破坏的工业材料可以是胶粘剂、胶水、纸、壁纸和木板/硬纸

板、纺织品、地毯、皮革、木材、纤维和薄纱、油漆和塑料制品、冷却润滑剂和其他可以被微生物污染或破坏的材料。可被微生物的增殖损害的生产设备的零件和建筑物,例如冷却水回路、冷却和加热系统以及通风和空调设备,也可以包括在待保护材料的范围内。在本发明范围内的工业材料优选包括胶粘剂、胶料(sizes)、纸和卡片、皮革、木材、油漆、冷却润滑剂和传热流体,更优选木材。

[0376] 式(I)的化合物和包含其的组合物可防止不良效果,例如腐烂、腐坏、变色、褪色或发霉。

[0377] 在处理木材的情况下,式(I)的化合物和包含其的组合物也可以用于抵抗易于在木材表面或内部生长的真菌病害。

[0378] 木材意指所有类型的木材品种,以及该木材的所有类型的意图用于建筑的加工品(working),例如实木、高密度木材、胶合板(laminated wood)和夹板(plywood)。此外,式(I)的化合物和包含其的组合物可用于保护与盐水或苦咸水接触的物体,尤其是船体(hulls)、筛(screens)、网(nets)、建筑物、系泊设备和信号系统,以免受污染。

[0379] 式(I)的化合物和包含其的组合物也可用于保护贮存物。贮存物理解为意指植物或动物来源的天然物质或其天然来源的加工产品,并且其需要长期保护。植物来源的贮存物,例如植物或植物部位,例如茎、叶、块茎、种子、果实、谷粒,可以在新鲜采收时或在通过(预)干燥、润湿、粉碎、研磨、压榨或烘烤加工后进行保护。贮存物还包括木材,为未加工的,例如建筑木材、电线杆和栅栏,或以成品形式,例如家具。动物来源的贮存物为例如兽皮、皮革、毛皮和毛发。式(I)的化合物和包含其的组合物可以预防多种不良效果,例如腐烂、腐坏、变色、褪色或发霉。

[0380] 能够降解或改变工业材料的微生物包括,例如细菌、真菌、酵母菌、藻类和粘质生物体。式(I)的化合物和包含其的组合物优选抗真菌,尤其是霉菌、木材变色菌(wood-discoloring fungi)和腐木菌(wood-destroying fungi)(子囊菌、担子菌、半知菌和接合菌),以及抗粘质生物体和藻类。实例包括以下属种的微生物:链格孢属,例如细链格孢(*Alternaria tenuis*);曲霉属,例如黑曲霉(*Aspergillus niger*);毛壳菌属(*Chaetomium*),例如球毛壳(*Chaetomium globosum*);粉孢革菌属(*Coniophora*),例如粉孢革菌(*Coniophora puetana*);香燕菌属(*Lentinus*),例如虎皮香燕菌(*Lentinus tigrinus*);青霉菌属,例如灰绿青霉(*Penicillium glaucum*);多孔菌属(*Polyporus*),例如变色多孔菌(*Polyporus versicolor*);短梗霉属(*Aureobasidium*),例如出芽短梗霉(*Aureobasidium pullulans*);核茎点属(*Sclerophoma*),例如*Sclerophoma pityophila*;木霉属(*Trichoderma*),例如绿色木霉(*Trichoderma viride*);线嘴壳属(*Ophiostoma* spp.)、长喙壳属(*Ceratocystis* spp.)、霉属(*Humicola* spp.)、彼得壳属(*Petriella* spp.)、毛束霉属(*Trichurus* spp.)、革盖菌属(*Coriolus* spp.)、粘褶菌属(*Gloeophyllum* spp.)、侧耳属(*Pleurotus* spp.)、卧孔菌属(*Poria* spp.)、干朽菌属(*Serpula* spp.)和干酪菌属(*Tyromyces* spp.)、枝孢菌属、拟青霉属(*Paecilomyces* spp.)、毛霉属(*Mucor* spp.)、埃希氏菌属(*Escherichia*),例如大肠杆菌(*Escherichia coli*);假单胞菌属(*Pseudomonas*),例如绿脓假单胞菌(*Pseudomonas aeruginosa*);葡萄球菌属(*Staphylococcus*),例如金黄色酿脓葡萄球菌(*Staphylococcus aureus*)、假丝酵母属(*Candida* spp.)和酵母属(*Saccharomyces* spp.),例如酿酒酵母(*Saccharomyces*

cerevisae)。

[0381] 种子处理

[0382] 式(I)的化合物和包含其的组合物还可用于保护种子免受不想要的微生物,如植物病原性微生物,例如植物病原性真菌或植物病原性卵菌的侵袭。本文中使用的术语种子包括休眠的种子、经催芽的种子、已发芽的种子和具有长出的根和叶的种子。

[0383] 因此,本发明还涉及一种用于保护种子免受不想要的微生物侵袭的方法,该方法包括使用式(I)的化合物或包含其的组合物处理种子的步骤。

[0384] 使用式(I)的化合物或包含其的组合物处理种子不仅保护种子,还保护发芽植物、幼苗和经处理的种子出苗后的植物,使其免受植物病原性微生物的侵袭。因此,本发明还涉及一种用于保护种子、发芽植物和幼苗的方法。

[0385] 可在播种前、播种时或其后不久进行种子处理。

[0386] 当在播种前进行种子处理时(例如,所谓的拌种应用),可如下进行种子处理:可将种子置于具有所需量的式(I)的化合物或包含其的组合物混合器中,混合种子和式(I)的化合物或包含其的组合物,直至实现在种子上的均匀分布。如果合适,然后可以干燥种子。

[0387] 本发明还涉及使用式(I)的化合物或包含其的组合物处理的种子。

[0388] 优选地,在其足够稳定使得在处理期间不发生损害的状态下处理种子。通常,可在采收和播种后不久之间的任意时间处理种子。通常使用已从植物中分离出来并且已经除去穗轴、外壳、茎、表皮、绒毛或果肉的种子。例如,可使用已经采收、清洁并且干燥至含水量小于15重量%的种子。或者,也可使用例如干燥后用水处理然后再干燥的种子,或刚引发后的种子,或以催芽条件储存的种子或预发芽的种子,或在育苗盘、育苗带或育苗纸上播种的种子。

[0389] 施用至种子的式(I)的化合物或包含其的组合物通常为,使得种子的发芽不受损害,或所得植物不受损害。特别是在式(I)的化合物在某些施用率下会表现出植物毒性效应的情况下,必须确保这一点。当确定施用至种子的式(I)的化合物的量时,还应当考虑转基因植物的固有表现型,以使用最小量的化合物实现最佳的种子和发芽植物保护。

[0390] 式(I)的化合物可以其自身形式直接施用至种子,即,不使用任何其他组分,并且不经稀释。还可将包含其的组合物施用至种子。

[0391] 式(I)的化合物和包含其的组合物适于保护任意植物品种的种子。优选的种子为谷类(例如小麦、大麦、黑麦、粟、黑小麦和燕麦)、油菜、玉米、棉花、大豆、稻、马铃薯、向日葵、菜豆、咖啡、豌豆、甜菜(例如糖用甜菜和饲用甜菜)、花生、蔬菜(例如西红柿、黄瓜、洋葱和莴苣)、草坪植物和观赏植物的种子。更优选小麦、大豆、油菜、玉米和稻的种子。

[0392] 式(I)的化合物和包含其的组合物可用于处理转基因种子,特别是能够表达抗害虫、抗除草损害或抗非生物胁迫的多肽或蛋白从而增加保护作用的植物的种子。能够表达抗害虫、抗除草损害或抗非生物胁迫的多肽或蛋白的植物的种子可含有至少一种异源基因,该异源基因允许表达所述多肽或蛋白。转基因种子中的这些异源基因可源于例如以下微生物菌属:芽孢杆菌属(Bacillus)、根瘤菌属(Rhizobium)、假单胞菌属(Pseudomonas)、沙雷氏菌属(Serratia)、木霉菌属、棒形杆菌属(Clavibacter)、球囊霉属(Glomus)或粘帚霉属(Gliocladium)。这些异源基因优选来源于芽孢杆菌属(Bacillus sp.),在这种情况下,基因产物可以有效抵抗欧洲玉米螟和/或西方玉米根虫。特别优选地,所述异源基因来

源于苏云金芽孢杆菌 (*Bacillus thuringiensis*)。

[0393] 应用

[0394] 式 (I) 的化合物可以其本身的形式应用, 或例如以可即用的溶液剂、乳液剂、水基悬浮剂或油基悬浮剂、粉剂、可湿性粉剂、糊剂、可溶性粉剂、尘剂、可溶性颗粒剂、可传播颗粒剂、悬乳浓缩剂、经式 (I) 的化合物浸渍的天然产物、经式 (I) 的化合物浸渍的合成物质、肥料或聚合物中的微胶囊剂的形式应用。

[0395] 以常规方式完成施用, 例如通过灌溉、喷洒、雾化、撒播、粉化、发泡、涂抹等。也可通过超低容量法、通过滴灌系统或灌溉施用来施用式 (I) 的化合物, 将其施用于垄沟内或将其注入到土壤茎 (soil stem) 或植物躯干 (trunk) 中。还可通过植物创伤包扎物 (wound seal)、敷料 (paint) 或其他创伤敷料 (wound dressing) 来施用式 (I) 的化合物。

[0396] 施用至植物、植物部位、果实、种子或土壤的式 (I) 的化合物的有效且植物相容的量取决于多种因素, 例如使用的化合物/组合物、处理对象 (植物、植物部位、果实、种子或土壤)、处理类型 (粉化、喷洒、拌种)、处理目的 (治疗性的和保护性的)、微生物的类型、微生物的发育阶段、微生物的敏感性、作物生长阶段和环境条件。

[0397] 当使用式 (I) 的化合物作为杀真菌剂时, 施用率可根据施用的种类而在相对宽的范围内变化。对于植物部位如叶的处理, 施用率范围可以为 0.1-10000g/ha、优选 10-1000g/ha、更优选 50-300g/ha (在通过灌溉或滴灌施用的情况下, 甚至可降低施用率, 尤其是当使用惰性物质如岩棉或珍珠岩时)。对于种子的处理, 施用率范围可以为 0.1-200g/100 kg 种子、优选 1-150g/100kg 种子、更优选 2.5-25g/100kg 种子、甚至更优选 2.5-12.5g/100kg 种子。对于土壤的处理, 施用率范围可以为 0.1-10000g/ha、优选 1-5000g/ha。

[0398] 这些施用率仅仅是示例, 并且不意图限制本发明的范围。

[0399] 可根据以下实施例进一步理解本教导的各个方面, 所述实施例不应被解释为以任何方式限制本教导的范围。

## 实施例

[0400] 制备实施例

[0401] 在以下实施例中, logP 值和质量峰如表 1 中所定义。

[0402] 制备实施例 1: 7, 8-二氟-N-[2-(1-甲基-1H-吡唑-5-基)-3-噻吩基] 喹啉-3-胺 (化合物 I.13) 的制备

[0403] 步骤 1: 1-(3-溴-2-噻吩基)-3-(二甲基氨基) 丙-2-烯-1-酮的制备

[0404] 将 6g (29.2mmol) 1-(3-溴-2-噻吩基) 乙酮和 4g 1,1-二甲氧基-N,N-二甲基甲胺 (117mmol) 在 20mL 二甲基甲酰胺 (DMF) 中的溶液在 110°C 下加热 2 小时。将反应混合物冷却至室温, 用水稀释, 并用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层用 ChemElut™ 柱干燥, 并在真空中浓缩, 得到 6.8g (87%) 的棕色固体 1-(3-溴-2-噻吩基)-3-(二甲基氨基) 丙-2-烯-1-酮, 其原样用于下一步骤中。LogP=1.82。Mass (M+H)=260。

[0405] 步骤 2: 5-(3-溴-2-噻吩基)-1-甲基-1H-吡唑 (中间体 IXe.01) 的制备

[0406] 将 3g (11.5mmol) 1-(3-溴-2-噻吩基)-3-(二甲基氨基) 丙-2-烯-1-酮和 2.16g (15mmol) 硫酸乙肼 (1:1) 与 4.47g (34.5mmol) N,N-二异丙基胺的溶液一起回流加热 16 小时。将反应混合物冷却至室温, 并在真空中浓缩。粗产物通过硅胶柱色谱法 (120g 柱-梯度正庚

烷/乙酸乙酯) 纯化,得到2.41g (77%)的90%纯度的黄色液体5-(3-溴-2-噻吩基)-1-甲基-1H-吡唑。LogP=2.29。Mass (M+H) = 243。

[0407] 步骤3:7,8-二氟-N-[2-(1-甲基-1H-吡唑-5-基)-3-噻吩基]喹啉-3-胺 (化合物I.13)的制备

[0408] 在5mL的微波管中,在氩气下将100mg (0.55mmol) 7,8-二氟喹啉-3-胺和148mg (0.61mmol)的5-(3-溴-2-噻吩基)-1-甲基-1H-吡唑溶于3mL的无水1,4-二噁烷中。加入25mg (0.028mmol)的三(二亚苄基丙酮)钨和33mg (0.058mmol) 4,5-双(二苄基-膦基)-9,9-二甲基咕吨 [XantPhos],并将反应混合物在140°C下微波加热1小时。将反应混合物冷却至室温,用水稀释,并用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层用 ChemElut™柱干燥,并在真空中浓缩。粗产物通过制备型HPLC (梯度乙腈/水+0.1% HCO<sub>2</sub>H) 纯化,得到101mg (52%) 7,8-二氟-N-[2-(1-甲基-1H-吡唑-5-基)-3-噻吩基]喹啉-3-胺。LogP=2.71。Mass (M+H) = 343。

[0409] 制备实施例2:N-[2-氯-3-(1-甲基-1H-吡唑-5-基)吡啶-4-基]-7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-胺 (化合物I.29)的制备

[0410] 在5mL的微波管中,在氩气下将185mg (0.48mmol) N-(3-溴-2-氯吡啶-4-基)-7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-胺和120mg (0.57mmol)的1-甲基-5-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂戊硼烷-2-基)-1H-吡唑溶于3mL的无水1,4-二噁烷中。加入44mg (0.048mmol) 三(二亚苄基丙酮)钨、39mg (0.096mmol) 二环己基(2',6'-二甲氧基联苯-2-基)膦[S-Phos]和183mg (1.2mmol) 氟化铯,并将反应混合物在150°C下微波加热1小时。将反应混合物冷却至室温,用乙酸乙酯稀释,并通过celite™塞过滤。将滤液在真空中浓缩,并通过硅胶柱色谱法(25g柱-梯度正庚烷/乙酸乙酯)纯化,得到13mg (6%) 固体N-[2-氯-3-(1-甲基-1H-吡唑-5-基)吡啶-4-基]-7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-胺。LogP=2.27。Mass (M+H) = 386。

[0411] 制备实施例3:N-[5-氯-4-(1-丙基-1H-吡唑-5-基)吡啶-3-基]-5,6-二氟-3-甲基喹啉-2-胺 (化合物I.35)的制备

[0412] 步骤1:5-氯-4-(1-丙基-1H-吡唑-5-基)吡啶-3-胺 (化合物XIc.05) 的制备

[0413] 依次向10mL用氩气脱气的1,4-二噁烷溶液中加入250mg (1.20 mmol) 4-溴-5-氯吡啶-3-胺、426mg (1.80mmol) 1-丙基-5-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂戊硼烷-2-基)-1H-吡唑、549mg (3.61mmol) 氟化铯、55mg (0.06mmol) 三(二亚苄基丙酮)钨(0)和49mg (0.474mmol) S-Phos。将反应混合物在130°C下微波加热30分钟。将冷却的反应混合物用乙酸乙酯稀释,并用Celite™垫过滤。将有机相用盐水洗涤,并用硫酸镁干燥。将有机相在真空下浓缩,并通过硅胶柱色谱法(12g柱-梯度正庚烷/乙酸乙酯)纯化,得到85mg (29%) 5-氯-4-(1-丙基-1H-吡唑-5-基)吡啶-3-胺。LogP=1.64。

[0414] 步骤2:N-[5-氯-4-(1-丙基-1H-吡唑-5-基)吡啶-3-基]-5,6-二氟-3-甲基-喹啉-2-胺 (化合物I.35)的制备

[0415] 向66mg (0.25mmol) 2-溴-5,6-二氟-3-甲基喹啉和60mg (0.25 mmol) 5-氯-4-(1-丙基-1H-吡唑-5-基)吡啶-3-胺以及249mg (0.76mmol) 碳酸铯和14mg (0.025mmol) Xantphos在10mL脱气的1,4-二噁烷中的混合物中加入6mg (0.013mmol) 氯化钨( $\pi$ -肉桂基)二聚体。将反应混合物加热回流2.5小时。将冷却的反应混合物用乙酸乙酯稀释,并经Celite™垫过滤。将有机相在真空下浓缩,并通过硅胶柱色谱法(12g柱-梯度正庚烷/乙酸乙酯)纯化,得到42mg (39%) 白色粉末N-[5-氯-4-(1-丙基-1H-吡唑-5-基)吡啶-3-基]-5,

6-二氟-3-甲基-喹啉-2-胺。LogP = 3.44。Mass (M+H) = 415。

[0416] 制备实施例4:7,8-二氟-2-甲基-3- {[4-(1-甲基-1H-吡唑-5-基)-3-噻吩基]甲基}喹啉 (化合物I.38) 的制备

[0417] 步骤1:3-溴-4-(氯甲基)噻吩的制备

[0418] 向1g (5.02mmol) (4-溴-3-噻吩基) 甲醇和770mg (7.53mmol) 三乙胺在20mL二氯甲烷中的混合物中加入867mg (7.53mmol) 甲磺酰氯。将反应混合物在环境温度下搅拌过夜。将混合物在真空中浓缩,得到3.19g橙色油状的残余物。将残余物通过硅胶柱色谱法 (40g柱-梯度正庚烷/乙酸乙酯) 纯化,得到1.01g (95%) 浅黄色油3-溴-4-(氯甲基)噻吩。LogP = 2.99。Mass (M+H): 没有电离。气质联用 (GC-mass) Mass (M) = 210。

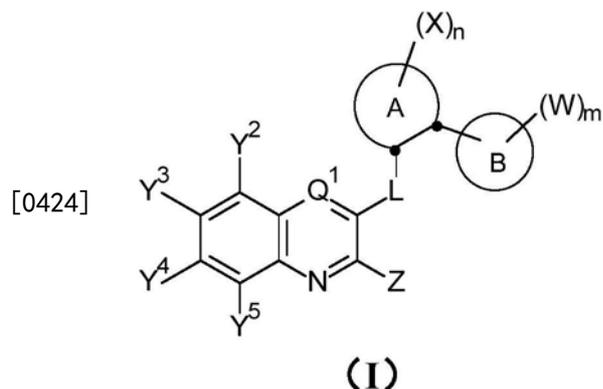
[0419] 步骤2:3-[ (4-溴-3-噻吩基) 甲基]-7,8-二氟-2-甲基喹啉 (IIe.02) 的制备

[0420] 在5mL的微波管中,将99mg (0.43mmol) (7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基) 硼酸和100mg (0.47mmol) 3-溴-4-(氯甲基)噻吩溶于4mL的1,4-二噁烷中。加入178mg (1.29mmol) 碳酸钾在1mL水中的溶液,并用氩气将反应混合物脱气5分钟。进一步加入24.8mg (0.021mmol) 的四(三苯基膦) 钯 (0),并将反应混合物在100°C下微波加热20分钟。相同的反应再重复4次。将合并的5批反应混合物倒入100mL水中,并用乙酸乙酯再萃取。将有机相用硫酸镁干燥,并在真空中浓缩,得到978 mg橙色固体形式的残余物。将残余物通过硅胶柱色谱法 (80g柱-梯度正庚烷/乙酸乙酯) 纯化,得到609mg (80%) 浅黄色固体3-[ (4-溴-3-噻吩基) 甲基]-7,8-二氟-2-甲基喹啉。LogP = 4.00。Mass (M+H) = 354。

[0421] 步骤3:7,8-二氟-2-甲基-3- {[4-(1-甲基-1H-吡唑-5-基)-3-噻吩基]甲基}喹啉 (化合物I.38) 的制备

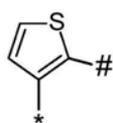
[0422] 在5mL的微波管中,将100mg (0.28mmol) 3-[ (4-溴-3-噻吩基) 甲基]-7,8-二氟-2-甲基喹啉和234mg (1.12mmol) 1-甲基-5-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂戊硼烷-2-基)-1H-吡唑溶于5mL的1,4-二噁烷中。加入129mg (0.84mmol) 氟化铯以及12mg (0.028mmol) S-Phos,并用氩气将反应混合物脱气5分钟。进一步加入13mg (0.014mmol) 三(二亚苄基丙酮) 钯 (0),并将反应混合物在150°C下微波加热3小时。将冷却的反应混合物用硅胶垫过滤,并将垫用乙酸乙酯洗涤。将有机相在真空中浓缩,并通过硅胶柱色谱法 (40g柱-梯度正庚烷/乙酸乙酯) 纯化,得到85mg (82%) 的固体7,8-二氟-2-甲基-3- {[4-(1-甲基-1H-吡唑-5-基)-3-噻吩基]甲基}喹啉。LogP = 3.01。Mass (M+H) = 356。

[0423] 表1以非限制性方式说明了式 (I) 的化合物的实例:

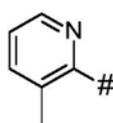


[0425] 其中A可选自以下基团:A-G1、A-G2、A-G3、A-G4、A-G5、A-G6、A-G7、A-G8、A-G9、

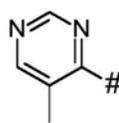
A-G10和A-G11:



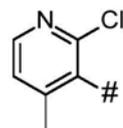
A-G1



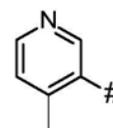
A-G2



A-G3

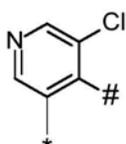


A-G4

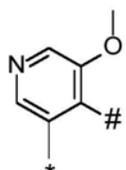


A-G5

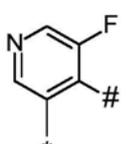
[0426]



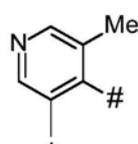
A-G6



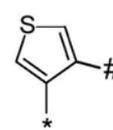
A-G7



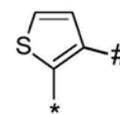
A-G8



A-G9



A-G10



A-G11

[0427] 其中基团A-Gn通过用“\*”标识的键与式(I)的L连接,基团A-Gn 通过用“#”标识的键与式(I)的B环连接。

[0428] 表1中所示化合物类似于上文提供的实施例制备。

[0429] 在表1中,使用下文所述方法根据EEC Directive 79/831Annex V.A8通过反相色谱柱(C 18)上的HPLC(高效液相色谱)测定logP 值:

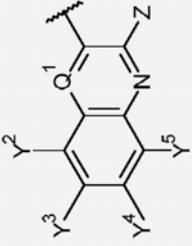
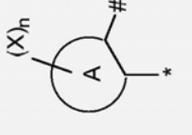
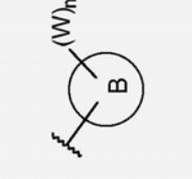
[0430] 温度:40℃;流动相:0.1%的甲酸水溶液和乙腈;线性梯度为10%乙腈至95%乙腈;

[0431] 如果在同一方法中获得多于一个LogP值,则给出所有值并通过“;”隔开。

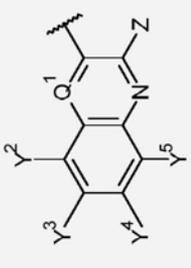
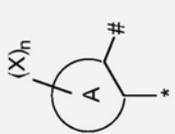
[0432] 使用具有已知logP值的直链的烷-2-酮(包括3至16个碳原子)进行校准(使用两种连续的烷酮之间的线性内插法通过保留时间测定logP 值)。使用200nm至400nm的UV-光谱和色谱信号的峰值测定λ最大值。

[0433]

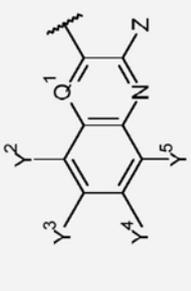
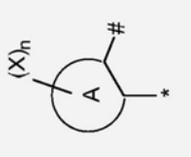
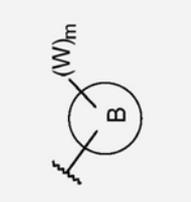
表 1:

实施例		L			M+H	logP
I.01	3-甲基喹啉-2-基	NH	A-G2	1-甲基-1H-吡啶-5-基	317	1.88
I.02	8-氟喹啉-3-基	NH	A-G2	1-甲基-1H-吡啶-5-基	320	1.72
I.03	4-甲基喹啉-3-基	NH	A-G1	1-甲基-1H-吡啶-5-基	321	1.39
I.04	3-甲基喹啉-2-基	NH	A-G1	1-甲基-1H-吡啶-5-基	322	2.47
I.05	8-氟喹啉-3-基	NH	A-G1	1-甲基-1H-吡啶-5-基	325	2.49
I.06	4-甲基喹啉-3-基	NH	A-G1	1-乙基-1H-吡啶-5-基	335	1.60
I.07	3-甲基喹啉-2-基	NH	A-G1	1-乙基-1H-吡啶-5-基	336	2.80
I.08	4-氟喹啉-3-基	NH	A-G2	1-甲基-1H-吡啶-5-基	336	2.02
I.09	7,8-二氟喹啉-3-基	NH	A-G2	1-甲基-1H-吡啶-5-基	338	1.93
I.10	5,6-二氟喹啉-2-基	NH	A-G2	1-甲基-1H-吡啶-5-基	339	2.13
I.11	8-氟喹啉-3-基	NH	A-G1	1-乙基-1H-吡啶-5-基	339	2.75
I.12	4-氟喹啉-3-基	NH	A-G1	1-甲基-1H-吡啶-5-基	341	2.66

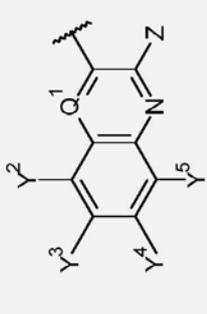
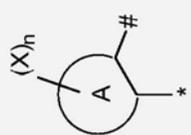
[0434]

实施例		L			M+H	logP
I.13	7,8-二氟喹啉-3-基	NH	A-G1	1-甲基-1H-吡唑-5-基	343	2.71
I.14	5,6-二氟喹啉-2-基	NH	A-G1	1-甲基-1H-吡唑-5-基	344	2.94
I.15	7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基	CH <sub>2</sub>	A-G2	1-甲基-1H-吡唑-5-基	351	2.17
I.16	7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基	NH	A-G2	1-甲基-1H-吡唑-5-基	352	2.04
I.17	5,6-二氟-3-甲基喹啉-2-基	NH	A-G2	1-甲基-1H-吡唑-5-基	353	2.23
I.18	7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基	CH <sub>2</sub>	A-G2	3-噻吩基	353	2.05
I.19	5,6-二氟-3-甲基喹啉-2-基	NH	A-G3	1-甲基-1H-吡唑-5-基	354	2.00
I.20	4-氟喹啉-3-基	NH	A-G1	1-乙基-1H-吡唑-5-基	355	2.98
I.21	7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基	NH	A-G1	1-甲基-1H-吡唑-5-基	357	2.74
I.22	7,8-二氟喹啉-3-基	NH	A-G1	1-乙基-1H-吡唑-5-基	357	2.92
I.23	5,6-二氟喹啉-2-基	NH	A-G1	1-乙基-1H-吡唑-5-基	358	3.29
I.24	5,6-二氟-3-甲基喹啉-2-基	NH	A-G1	1-甲基-1H-吡唑-5-基	358	2.90
I.25	7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基	NH	A-G1	1-乙基-1H-吡唑-5-基	371	3.11

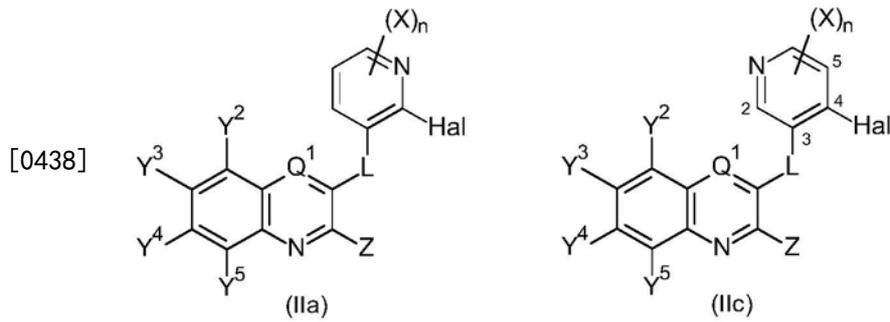
[0435]

实施例		L			M+H	logP
I.26	5,6-二氟-3-甲基噻唑啉-2-基	NH	A-G1	1-乙基-1H-吡唑-5-基	372	3.27
I.27	5,6-二氟-3-甲基噻唑啉-2-基	NH	A-G5	1-丙基-1H-吡唑-5-基	381	2.33
I.28	7,8-二氟-2-甲基噻唑啉-3-基	NH	A-G8	1-乙基-1H-吡唑-5-基		2.60
I.29	7,8-二氟-2-甲基噻唑啉-3-基	NH	A-G4	1-甲基-1H-吡唑-5-基	386	2.27
I.30	5,6-二氟-3-甲基噻唑啉-2-基	NH	A-G7	1-乙基-1H-吡唑-5-基	397	2.28
I.31	7,8-二氟-2-甲基噻唑啉-3-基	NH	A-G8	1-丙基-1H-吡唑-5-基		2.86
I.32	5,6-二氟-3-甲基噻唑啉-2-基	NH	A-G6	1-乙基-1H-吡唑-5-基	401	3.06
I.33	5,6-二氟-3-甲基噻唑啉-2-基	NH	A-G7	1-丙基-1H-吡唑-5-基	411	2.64
I.34	7,8-二氟-2-甲基噻唑啉-3-基	NH	A-G4	1-丙基-1H-吡唑-5-基	414	2.82
I.35	5,6-二氟-3-甲基噻唑啉-2-基	NH	A-G6	1-丙基-1H-吡唑-5-基	415	3.44
I.36	8-氟噻唑啉-3-基	CH <sub>2</sub>	A-G10	1-甲基-1H-吡唑-5-基	324	2.49
I.37	8-氟噻唑啉-3-基	CH <sub>2</sub>	A-G10	3-噻吩基	326	3.77
I.38	7,8-二氟-2-甲基噻唑啉-3-基	CH <sub>2</sub>	A-G10	1-甲基-1H-吡唑-5-基	356	3.01

[0436]

实施例		L			M+H	logP
I.39	7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基	CH <sub>2</sub>	A-G10	3-噻吩基	358	4.47
I.40	7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基	NH	A-G9	1-丙基-1H-吡唑-5-基		2.11
I.41	7-氟-8-甲氧基-2-甲基喹啉-3-基	NH	A-G8	1-乙基-1H-吡唑-5-基		2.22
I.42	7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基	NH	A-G7	1-乙基-1H-吡唑-5-基		2.06
I.43	7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基	NH	A-G6	1-乙基-1H-吡唑-5-基		2.86
I.44	7-氟-8-甲氧基-2-甲基喹啉-3-基	NH	A-G8	1-丙基-1H-吡唑-5-基		2.51
I.45	7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基	NH	A-G7	1-丙基-1H-吡唑-5-基		2.30
I.46	7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基	NH	A-G6	1-丙基-1H-吡唑-5-基		3.20
I.47	8-氟喹啉-3-基	CH <sub>2</sub>	A-G11	1-(乙氧基甲基)-1H-吡唑-5-基	368	3.10
I.48	7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基	CH <sub>2</sub>	A-G11	1-(乙氧基甲基)-1H-吡唑-5-基	400	3.64

[0437] 表2以非限制性方式说明了本文中公开的式(IIa)和(IIc)的化合物:



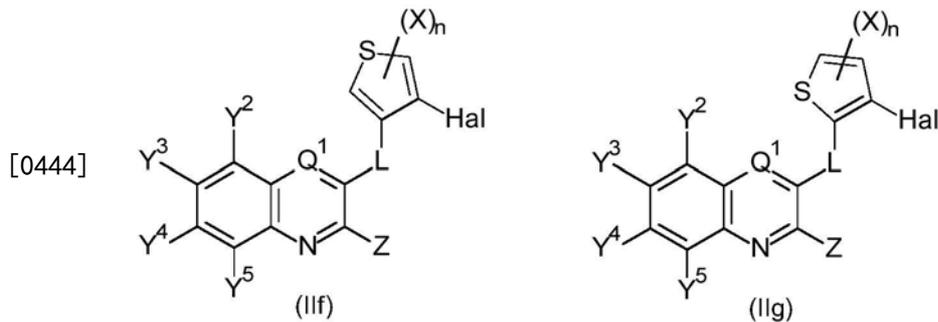
[0439] 在表2中, M+H (ApcI+) 和logP如表1所定义。

[0440] 在表2中, (X)<sub>n</sub> 残基与吡啶环的连接点基于吡啶环的以上编号计。

[0441] 表2:

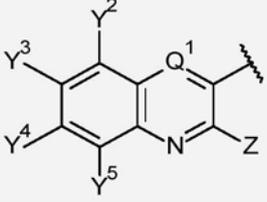
实施例		L	(X) <sub>n</sub>	Hal	M+H	logP
[0442] IIa.01	7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基	CH <sub>2</sub>	-	Br	349	2.92
IIa.02	8-氟喹啉-3-基	NSO <sub>2</sub> Me	-	Cl	352	2.07
IIc.01	5,6-二氟-3-甲基喹喔啉-2-基	NH	-	Cl	307	2.41
IIc.02	7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基	NH	5-F	I		2.94

[0443] 表3以非限制性方式说明了本文中公开的式 (IIIf) 和 (IIIg) 的化合物:

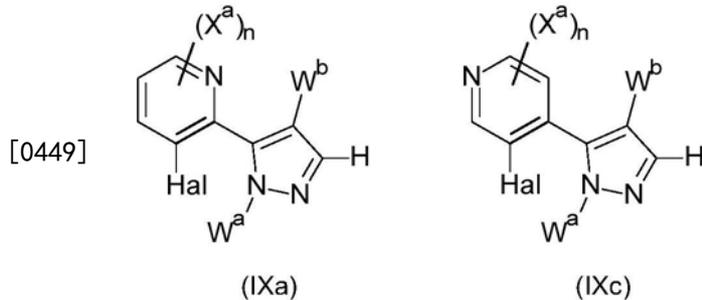


[0445] 在表3中, M+H (ApcI+) 和logP如表1所定义。

[0446] 表3:

实施例		L	(X) <sub>n</sub>	Hal	M+H	logP
[0447] IIf.01	8-氟喹啉-3-基	CH <sub>2</sub>	-	Br	322	3.36
IIf.02	7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基	CH <sub>2</sub>	-	Br	354	4.00
IIg.01	8-氟喹啉-3-基	CH <sub>2</sub>	-	Br	322	3.50
IIg.02	7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基	CH <sub>2</sub>	-	Br		4.19

[0448] 表4以非限制性方式说明了本文中公开的式 (IXa) 和 (IXc) 的化合物:

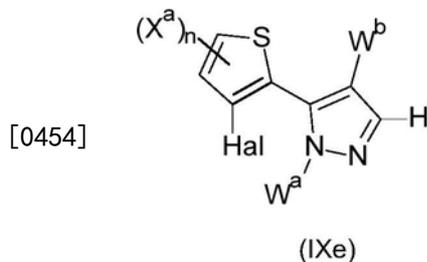


[0450] 在表4中, M+H (ApcI+) 和 logP 如表1所定义。

[0451] 表4:

实施例	Hal	(X) <sub>n</sub>	W <sup>a</sup>	W <sup>b</sup>	M+H	logP
[0452] IXa.01	Br	-	甲基	H	257	1.53
IXc.01	Cl	-	乙基	H		1.73

[0453] 表5以非限制性方式说明了本文中公开的式 (IXe) 的化合物:

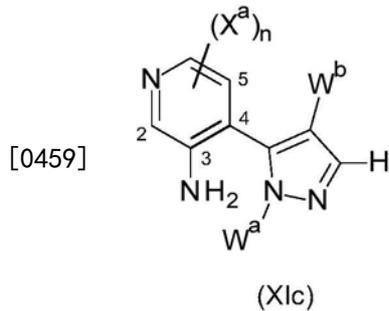


[0455] 在表5中, M+H (ApcI+) 和 logP 如表1所定义。

[0456] 表5:

实施例	Hal	(X <sup>a</sup> ) <sub>n</sub>	W <sup>a</sup>	W <sup>b</sup>	M+H	logP
[0457] IXe.01	Br	-	甲基	H	243	2.29
IXe.02	Br	-	乙基	H	257	2.72

[0458] 表6以非限制性方式说明了本文中公开的式 (XIc) 的化合物:



[0460] 在表6中, logP如表1所定义。

[0461] 在表6中, (X)<sub>n</sub> 残基与吡啶环的连接点基于吡啶环的以上编号计。

[0462] 表6:

实施例	(X <sup>a</sup> ) <sub>n</sub>	W <sup>a</sup>	W <sup>b</sup>	M+H	logP
XIc.01	-	丙基	H		0.11
[0463] XIc.02	5-OMe	乙基	H		0.08
XIc.03	5-Cl	乙基	H		1.30
XIc.04	5-OMe	丙基	H		0.45
XIc.05	5-Cl	丙基	H		1.64

[0464] NMR峰列表

[0465] 以<sup>1</sup>H-NMR峰列表的形式说明所选实施例的<sup>1</sup>H-NMR数据。对于每个信号峰,列出了以ppm计的δ值和括号中的信号强度。

[0466] 尖峰信号的强度与NMR谱的打印实施例中的以cm计的信号高度相关并且显示了信号强度的真实关系。从宽信号中,可以显示几个峰或信号的中间部分以及它们与谱图中的最强信号相比的相对强度。

[0467] <sup>1</sup>H-NMR峰列表与常规的<sup>1</sup>H-NMR打印件相似,因此通常包含在常规的NMR说明中列出的所有峰。此外,与常规的<sup>1</sup>H-NMR打印件一样,它们可以显示溶剂的信号、同样是本发明目的的目标化合物的立体异构体的信号和/或杂质峰的信号。为显示在溶剂和/或水的δ-范围

内的化合物信号,在<sup>1</sup>H-NMR峰列表中示出了常见的溶剂峰,例如DMSO于 d6-DMSO中的峰和水的峰,并且平均来看通常具有高的强度。

[0468] 目标化合物的立体异构体的峰和/或杂质的峰通常具有比目标化合物(例如纯度>90%)的峰平均更低的强度。这样的立体异构体和/或杂质可以是特定的制备方法所特有的。因此,它们的峰可以通过“副产物指纹(side-products-fingerprints)”帮助识别对制备方法的再现性。

[0469] 使用已知方法(MestreC、ACD模拟,以及使用经验估算的预期值) 计算目标化合物的峰的专业人员可视需要任选地使用额外的强度过滤器来分离目标化合物的峰。这种分离与常规的<sup>1</sup>H-NMR说明中的挑选相关峰类似。

[0470] 可在研究公开数据库(the Research Disclosure Database)第564025 号的出版物“专利申请中的NMR峰列表数据的引用(Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications)”中找到峰列表的NMR-数据说明的其他详细信息。

[0471] 所选式(I)、(II)、(IX)或(XI)的化合物的NMR峰列表

**L01: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, d6-DMSO):**

δ= 8.6402 (1.4); 8.5837 (0.9); 8.5787 (0.9); 8.5682 (1.0); 8.5631 (0.9); 8.2799 (0.8); 8.2750 (0.8); 8.2527 (0.9); 8.2477 (0.8); 7.7742 (0.7); 7.7479 (0.9); 7.5751 (0.9); 7.5596 (0.9); 7.5480 (1.0); 7.5324 (1.0); 7.5249 (0.7); 7.5203 (0.8); 7.5056 (1.6); 7.5020 (2.2); 7.4376 (0.6); 7.4288 (0.5); 7.4184 (0.4); 7.4102 (0.7); 7.4013 (0.4); 7.3919 (0.4); 7.2532 (1.8); 7.2468 (1.8); 6.4610 (1.9); 6.4546 (1.8); 3.9312 (8.6); 3.3518 (16.0); 2.6160 (7.3); 2.5339 (1.4); 2.5281 (2.8); 2.5221 (3.8); 2.5160 (2.8); 2.5102 (1.4); 2.0959 (0.5); 0.0198 (2.4)

**L02: <sup>1</sup>H-NMR(499.9 MHz, CDCl<sub>3</sub>):**

δ= 8.7291 (2.1); 8.7238 (2.1); 8.3920 (1.4); 8.3892 (1.4); 8.3828 (1.4); 8.3800 (1.4); 7.7739 (1.3); 7.7706 (1.5); 7.7691 (1.6); 7.7656 (2.3); 7.7627 (1.4); 7.7486 (1.4); 7.7459 (1.3); 7.6071 (2.6); 7.6033 (2.6); 7.4753 (0.4); 7.4662 (2.4); 7.4631 (1.7); 7.4611 (1.7); 7.4587 (2.5); 7.4560 (1.4); 7.4478 (1.0); 7.3037 (1.3); 7.2945 (1.8); 7.2869 (1.7); 7.2773 (1.5); 7.2735 (0.8); 7.2688 (0.8); 7.2624 (7.2); 7.2556 (0.6); 6.5813 (2.8); 6.5775 (2.8); 6.2488 (1.3); 5.2986 (0.9); 4.0055 (16.0); 1.6069 (4.1); -0.0002 (7.0)

**L03: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):**

δ= 8.8164 (3.1); 8.0945 (0.9); 8.0889 (1.1); 8.0696 (0.7); 8.0662 (1.0); 8.0627 (1.1); 8.0511 (0.6); 8.0022 (0.9); 7.9982 (0.8); 7.9947 (0.7); 7.9760 (1.2); 7.9704 (1.1); 7.6696 (0.4); 7.6641 (0.5); 7.6467 (1.0); 7.6414 (0.9); 7.6371 (0.5); 7.6208 (2.0); 7.6139 (2.0); 7.6076 (2.6); 7.6012 (2.6); 7.5930 (1.0); 7.5881 (0.9); 7.5703 (0.4); 7.5652 (0.3); 7.4095 (2.0); 7.3914 (2.1); 7.2986 (6.2); 6.8679 (2.3); 6.8498 (2.2); 6.4977 (2.7); 6.4913 (2.6); 5.5681 (1.2); 3.9537 (16.0); 2.9924 (4.7); 2.9200 (4.0); 2.5575 (13.2); 1.7803 (0.3); 0.0359 (6.6)

[0472]

<p><b>L.04: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 8.4732 (2.2); 8.4549 (2.3); 7.9191 (1.0); 7.9150 (1.0); 7.8919 (1.1); 7.8878 (1.1); 7.8530 (0.9); 7.8494 (1.0); 7.8253 (1.2); 7.8219 (1.2); 7.6931 (2.4); 7.6868 (2.4); 7.6566 (0.6); 7.6518 (0.6); 7.6332 (0.9); 7.6287 (1.2); 7.6058 (0.7); 7.6009 (0.6); 7.5730 (2.0); 7.5547 (2.0); 7.5330 (0.9); 7.5281 (0.9); 7.5095 (0.7); 7.5054 (1.2); 7.5010 (0.8); 7.4824 (0.6); 7.4777 (0.5); 7.2987 (6.0); 6.9795 (1.0); 6.5430 (2.7); 6.5367 (2.7); 3.9401 (16.0); 2.9928 (1.0); 2.9215 (0.8); 2.5818 (11.9); 1.6425 (2.3); 0.0371 (6.5)</p>
<p><b>L.05: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 8.6641 (2.7); 8.6556 (2.4); 7.5857 (3.3); 7.5795 (3.2); 7.5748 (1.7); 7.5643 (2.3); 7.5591 (3.2); 7.5559 (3.2); 7.5509 (3.8); 7.5329 (2.3); 7.4469 (1.9); 7.4363 (3.9); 7.4285 (3.8); 7.4246 (2.9); 7.4187 (1.9); 7.3050 (4.3); 7.2986 (12.3); 7.2939 (5.4); 7.2811 (2.3); 7.2556 (0.8); 7.2511 (0.6); 7.2443 (0.8); 7.2371 (0.8); 7.2258 (0.9); 7.2203 (1.0); 7.2157 (0.7); 7.2085 (0.8); 7.2023 (0.8); 7.1903 (0.5); 6.4349 (3.5); 6.4286 (3.2); 6.4241 (1.3); 5.9610 (2.0); 3.8710 (16.0); 3.8665 (7.0); 2.9935 (1.2); 2.9205 (1.1); 1.6234 (7.9); 0.0428 (3.4); 0.0363 (10.0); 0.0317 (4.2)</p>
<p><b>L.06: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 8.8156 (4.3); 8.0949 (1.1); 8.0891 (1.4); 8.0661 (1.2); 8.0630 (1.4); 8.0515 (0.5); 7.9999 (1.2); 7.9950 (1.1); 7.9918 (0.8); 7.9727 (1.5); 7.9673 (1.4); 7.6686 (0.5); 7.6632 (0.6); 7.6480 (3.6); 7.6419 (4.0); 7.6195 (2.0); 7.6126 (2.0); 7.5948 (0.6); 7.5905 (1.1); 7.5857 (1.0); 7.5678 (0.5); 7.5628 (0.4); 7.4109 (2.5); 7.3928 (2.6); 7.2983 (7.1); 6.8691 (2.9); 6.8510 (2.7); 6.4841 (3.2); 6.4779 (3.2); 5.5512 (1.6); 4.3010 (1.2); 4.2769 (3.9); 4.2528 (4.0); 4.2288 (1.3); 2.9921 (3.6); 2.9199 (3.2); 2.6084 (0.3); 2.5480 (16.0); 1.7623 (0.4); 1.4851 (4.2); 1.4610 (8.9); 1.4369 (4.0); 0.0359 (7.4)</p>
<p><b>L.07: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 8.4987 (2.9); 8.4804 (3.0); 7.9155 (1.3); 7.9112 (1.3); 7.8883 (1.5); 7.8840 (1.5); 7.8574 (1.2); 7.8534 (1.3); 7.8299 (1.6); 7.8258 (1.6); 7.7290 (3.1); 7.7229 (3.1); 7.6564 (0.8); 7.6516 (0.8); 7.6330 (1.2); 7.6285 (1.5); 7.6056 (0.9); 7.6007 (0.8); 7.5721 (2.8); 7.5537 (2.7); 7.5304 (1.1); 7.5257 (1.2); 7.5066 (1.0); 7.5028 (1.6); 7.4987 (1.1); 7.4799 (0.7); 7.4753 (0.7); 7.2986 (7.2); 6.9466 (1.5); 6.5242 (3.3); 6.5181 (3.3); 4.2720 (1.3); 4.2479 (4.1); 4.2238 (4.2); 4.1998 (1.4); 2.9926 (1.5); 2.9208 (1.3); 2.5515 (16.0); 1.6449 (4.7); 1.4730 (4.4); 1.4490 (9.2); 1.4249 (4.2); 0.0370 (7.7)</p>
<p><b>L.08: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 8.9575 (4.6); 8.4168 (1.6); 8.4125 (1.6); 8.4015 (1.7); 8.3972 (1.6); 8.1654 (1.1); 8.1601 (0.8); 8.1525 (0.7); 8.1433 (1.0); 8.1415 (1.0); 8.1331 (1.3); 8.1131 (1.1); 8.1054 (0.9); 8.0935 (0.7); 8.0854 (1.0); 8.0815 (1.3); 7.7187 (0.5); 7.7024 (1.5); 7.6941 (2.1); 7.6818 (2.8); 7.6691 (2.0); 7.6613 (1.4); 7.6457 (3.1); 7.6395 (3.0); 7.6143 (1.5); 7.6105 (1.4); 7.5866 (1.7); 7.5827 (1.6); 7.2985 (2.5); 7.2827 (1.3); 7.2704 (1.2); 7.2550 (1.1); 6.7034 (3.0); 6.6970 (2.9); 6.4894 (1.9); 5.3231 (2.3); 4.0673 (16.0); 0.0274 (1.2)</p>
<p><b>L.09: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</b></p> <p>δ= 8.7646 (2.0); 8.7559 (2.0); 8.4918 (1.4); 8.4870 (1.5); 8.4765 (1.5); 8.4717 (1.5); 8.4385 (2.4); 7.9373 (1.2); 7.9327 (1.2); 7.9098 (1.4); 7.9052 (1.3); 7.6255 (2.6); 7.6054 (2.2); 7.5939 (2.5); 7.5726 (0.8); 7.4987 (1.3); 7.4834 (1.3); 7.4713 (1.2); 7.4560 (1.1); 7.3985 (3.0); 7.3921 (3.0); 6.4909 (3.2); 6.4844 (3.1); 3.9096 (14.0); 3.3500 (16.0); 2.5340 (2.2); 2.5281 (4.5); 2.5220 (6.1); 2.5160 (4.4); 2.5101 (2.1); 0.0190 (5.4)</p>
<p><b>L.10: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</b></p> <p>δ= 9.6567 (1.5); 8.6167 (2.6); 8.5720 (0.9); 8.5669 (1.0); 8.5566 (1.0); 8.5515 (1.0); 8.3788 (0.9); 8.3738 (0.9); 8.3513 (1.0); 8.3463 (0.9); 7.7475 (0.5); 7.7199 (0.5); 7.7161 (0.5); 7.6850 (0.3); 7.5628 (1.0); 7.5474 (1.0); 7.5353 (0.9); 7.5199 (0.9); 7.4579 (0.4); 7.4510 (0.5); 7.4416 (0.5); 7.4346 (0.5); 7.4265 (0.4); 7.4197 (0.4); 7.4102 (0.4); 7.4035 (0.4); 7.3822 (2.0); 7.3757 (2.0); 6.4639 (2.1); 6.4574 (2.1); 3.9307 (9.5); 3.3473 (16.0); 2.5341 (2.4); 2.5282 (5.0); 2.5221 (6.9); 2.5160 (5.0); 2.5101 (2.4); 0.0197 (5.9)</p>
<p><b>L.11: <sup>1</sup>H-NMR(400.1 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</b></p> <p>δ= 8.6731 (5.3); 8.6665 (5.4); 8.5791 (5.9); 7.9605 (0.6); 7.8141 (5.7); 7.8006 (6.0); 7.5048 (2.7); 7.4846 (10.5); 7.4802 (8.1); 7.4180 (1.4); 7.4051 (1.6); 7.3942 (3.7); 7.3864 (5.4); 7.3654 (1.2); 7.2918 (5.9); 7.2783 (5.7); 7.2296 (1.8); 7.2103 (1.6); 7.2039 (1.9); 7.2018 (1.9); 7.1847 (1.5); 7.1825 (1.5); 6.4154 (6.8); 6.4109 (6.9); 4.0298 (2.1); 4.0118 (6.8); 3.9939 (7.0); 3.9759 (2.2); 3.3143 (28.4); 2.8979 (4.1); 2.7392 (3.6); 2.5132 (8.0); 2.5088 (10.9); 2.5044 (8.1); 1.2218 (7.3); 1.2039 (16.0); 1.1859 (7.3)</p>

[0473]

<p><b>I.12: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 8.8289 (4.0); 8.1046 (0.9); 8.0975 (0.9); 8.0838 (0.6); 8.0776 (0.9); 8.0720 (1.1); 8.0588 (1.2); 8.0545 (1.3); 8.0486 (0.8); 8.0349 (1.0); 8.0277 (1.0); 7.6616 (0.4); 7.6445 (1.2); 7.6385 (1.1); 7.6324 (1.3); 7.6221 (2.6); 7.6119 (1.1); 7.6062 (1.0); 7.5999 (1.1); 7.5831 (0.5); 7.5767 (0.4); 7.5697 (2.4); 7.5633 (2.5); 7.5301 (2.1); 7.5121 (2.3); 7.2988 (5.7); 7.2016 (2.4); 7.1835 (2.2); 6.4702 (2.7); 6.4638 (2.7); 6.1450 (1.2); 3.9088 (16.0); 2.9924 (4.3); 2.9199 (3.6); 1.6895 (1.5); 0.0360 (6.1)</p>
<p><b>I.13: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 8.6981 (1.8); 8.6892 (1.8); 7.5866 (2.4); 7.5803 (2.5); 7.5513 (2.1); 7.5445 (1.4); 7.5394 (1.5); 7.5336 (3.1); 7.4129 (1.2); 7.4059 (1.3); 7.4013 (2.1); 7.3847 (2.4); 7.3718 (1.0); 7.2988 (17.6); 7.2703 (2.5); 7.2522 (2.1); 6.4307 (2.7); 6.4244 (2.7); 5.9165 (1.2); 3.8726 (16.0); 2.9949 (1.1); 2.9221 (0.9); 1.6059 (13.6); 0.0478 (0.7); 0.0370 (18.2); 0.0261 (0.6)</p>
<p><b>I.14: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</b></p> <p>δ= 8.6834 (0.5); 7.8330 (0.5); 7.7953 (0.5); 7.5267 (0.4); 7.5204 (0.4); 6.4662 (0.4); 6.4598 (0.4); 3.7173 (2.0); 3.3486 (16.0); 2.5343 (1.1); 2.5284 (2.2); 2.5223 (2.9); 2.5163 (2.1); 2.5103 (1.0); 0.0201 (3.4)</p>
<p><b>I.15: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 8.7369 (1.2); 8.7317 (1.2); 8.7213 (1.2); 8.7161 (1.1); 7.5646 (1.1); 7.5593 (1.1); 7.5384 (1.6); 7.5329 (1.7); 7.5262 (3.1); 7.5197 (3.2); 7.5114 (2.4); 7.4758 (0.5); 7.4709 (0.4); 7.4583 (0.6); 7.4526 (0.6); 7.4452 (1.0); 7.4404 (1.0); 7.4278 (0.9); 7.4224 (1.0); 7.4131 (0.9); 7.3911 (0.9); 7.3804 (2.2); 7.3640 (1.7); 7.3595 (1.3); 7.3537 (1.4); 7.3380 (1.1); 7.3284 (0.4); 7.2988 (3.0); 6.2455 (3.0); 6.2391 (2.8); 4.1774 (5.3); 3.8414 (16.0); 2.6269 (12.5); 1.2962 (1.4); 1.2868 (2.7); 1.2718 (0.9); 0.9108 (0.4); 0.8953 (0.4); 0.8877 (0.4); 0.8743 (0.4); 0.1051 (0.9); 0.0316 (3.5)</p>
<p><b>I.16: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 8.4198 (1.4); 8.4152 (1.4); 8.4045 (1.5); 8.3999 (1.4); 8.0532 (0.5); 7.8457 (2.4); 7.6495 (2.6); 7.6432 (2.6); 7.5900 (1.2); 7.5856 (1.2); 7.5622 (1.6); 7.5578 (1.5); 7.4565 (0.4); 7.4388 (0.5); 7.4349 (0.4); 7.4243 (1.5); 7.4157 (1.2); 7.4086 (1.1); 7.4044 (1.1); 7.3959 (1.0); 7.3853 (1.0); 7.3643 (1.0); 7.3370 (1.4); 7.3220 (1.3); 7.3095 (1.2); 7.2986 (8.6); 6.6039 (2.8); 6.5975 (2.8); 6.0911 (1.6); 5.3363 (3.6); 4.0606 (16.0); 3.9283 (0.5); 2.9936 (4.2); 2.9203 (3.7); 2.6962 (13.2); 1.6439 (8.1); 0.0349 (9.1); 0.0261 (0.3); 0.0244 (0.4)</p>
<p><b>I.17: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</b></p> <p>δ= 8.8952 (2.7); 8.6104 (1.6); 8.6054 (1.7); 8.5949 (1.8); 8.5898 (1.7); 8.1832 (1.6); 8.1781 (1.6); 8.1561 (1.8); 8.1510 (1.7); 7.6546 (0.5); 7.6233 (0.9); 7.5955 (0.8); 7.5917 (0.8); 7.5883 (0.8); 7.5796 (1.8); 7.5639 (1.9); 7.5525 (1.6); 7.5369 (1.6); 7.3594 (0.7); 7.3528 (0.8); 7.3429 (0.8); 7.3363 (0.8); 7.3283 (0.6); 7.3215 (0.7); 7.3117 (0.6); 7.3051 (0.6); 7.2366 (3.4); 7.2302 (3.5); 6.4280 (3.6); 6.4216 (3.6); 3.9231 (16.0); 3.3508 (11.3); 2.6631 (12.7); 2.5342 (1.6); 2.5282 (3.4); 2.5222 (4.7); 2.5162 (3.4); 2.5103 (1.6); 2.0961 (0.8); 0.0189 (6.1)</p>
<p><b>I.18: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 8.6828 (1.0); 7.5982 (3.0); 7.5055 (1.5); 7.4799 (1.9); 7.4663 (0.8); 7.4302 (3.5); 7.4123 (2.8); 7.4013 (2.4); 7.3955 (2.6); 7.3857 (1.8); 7.3798 (1.4); 7.3697 (1.5); 7.3427 (2.8); 7.3242 (1.8); 7.3161 (1.6); 7.2984 (3.7); 7.2734 (0.8); 4.2673 (7.0); 2.6631 (16.0); 1.5729 (0.4); 1.2896 (5.4); 1.2346 (0.4); 0.9123 (0.7); 0.8988 (1.1); 0.8888 (1.0); 0.8778 (1.1); 0.0333 (2.3)</p>
<p><b>I.19: <sup>1</sup>H-NMR(499.9 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 10.3636 (4.4); 9.0624 (4.7); 7.7161 (2.7); 7.7122 (2.6); 7.6316 (0.6); 7.6277 (0.6); 7.6221 (0.6); 7.6181 (0.6); 7.6130 (0.8); 7.6091 (0.8); 7.6034 (0.7); 7.5996 (0.7); 7.5360 (0.6); 7.5204 (0.8); 7.5167 (0.9); 7.5011 (0.9); 7.4820 (0.4); 7.4336 (1.4); 7.2620 (7.6); 6.7446 (2.9); 6.7408 (2.7); 4.1051 (16.0); 2.6665 (12.8); 2.0060 (7.4); 1.5742 (4.7); 0.0701 (0.7); 0.0061 (0.6); -0.0002 (8.1)</p>

[0474]

<p><b>L20: <sup>1</sup>H-NMR(400.1 MHz, d6-DMSO):</b></p> <p>δ= 8.4032 (10.6); 8.1359 (6.1); 8.0062 (3.0); 7.9874 (3.4); 7.9856 (3.3); 7.9610 (1.4); 7.8968 (3.1); 7.8773 (3.8); 7.8618 (0.5); 7.7905 (6.0); 7.7771 (6.2); 7.6615 (1.4); 7.6588 (1.5); 7.6413 (3.0); 7.6236 (2.2); 7.6206 (2.0); 7.5863 (2.3); 7.5829 (2.3); 7.5656 (3.2); 7.5484 (1.5); 7.5451 (1.3); 7.4913 (0.4); 7.4822 (0.5); 7.4739 (0.4); 7.4022 (2.0); 7.3887 (1.7); 7.3724 (1.8); 7.3577 (6.8); 7.3531 (6.8); 7.1813 (0.3); 7.1771 (0.3); 7.1420 (6.0); 7.1286 (5.9); 6.3434 (6.7); 6.3388 (6.6); 4.0989 (2.1); 4.0809 (6.9); 4.0629 (7.1); 4.0450 (2.4); 3.3144 (47.4); 2.8979 (8.8); 2.7395 (7.8); 2.5132 (10.4); 2.5088 (14.3); 2.5044 (10.7); 1.6542 (2.1); 1.2474 (7.4); 1.2294 (16.0); 1.2114 (7.7)</p>
<p><b>L21: <sup>1</sup>H-NMR(400.1 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 7.5390 (2.6); 7.5343 (2.6); 7.5183 (2.4); 7.5054 (4.3); 7.3187 (0.4); 7.3088 (2.4); 7.2936 (2.1); 7.2849 (1.1); 7.2694 (1.1); 7.2607 (5.8); 7.2465 (0.3); 7.1860 (2.6); 7.1725 (2.4); 6.3701 (2.8); 6.3654 (2.8); 5.6187 (1.6); 3.8535 (16.0); 2.6595 (13.3); 1.5980 (5.6); -0.0002 (5.0)</p>
<p><b>L22: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 8.6851 (4.1); 8.6763 (4.2); 8.6000 (0.4); 8.5911 (0.4); 7.6221 (5.2); 7.6159 (5.2); 7.5515 (5.3); 7.5435 (3.5); 7.5397 (3.5); 7.5346 (7.5); 7.4126 (3.1); 7.4083 (3.1); 7.4033 (3.7); 7.3855 (6.4); 7.3711 (2.6); 7.3499 (0.9); 7.3403 (0.5); 7.3316 (0.4); 7.2984 (21.0); 7.2735 (5.7); 7.2554 (4.9); 6.4086 (5.9); 6.4023 (5.8); 5.9158 (3.0); 5.3364 (2.9); 4.2154 (2.2); 4.1913 (6.9); 4.1672 (7.0); 4.1431 (2.3); 1.6165 (11.1); 1.4289 (7.6); 1.4048 (16.0); 1.3808 (7.3); 1.2919 (1.2); 0.0476 (0.8); 0.0367 (22.3); 0.0258 (0.7)</p>
<p><b>L23: <sup>1</sup>H-NMR(400.1 MHz, d6-DMSO):</b></p> <p>δ= 9.6260 (5.3); 8.6654 (9.5); 8.6391 (0.3); 7.9603 (1.3); 7.8403 (4.8); 7.8266 (7.4); 7.7787 (7.5); 7.7650 (5.4); 7.7395 (1.9); 7.7156 (1.8); 7.6923 (1.1); 7.5537 (6.7); 7.5491 (6.8); 7.4976 (1.5); 7.4930 (1.6); 7.4854 (1.6); 7.4807 (1.7); 7.4743 (1.4); 7.4696 (1.4); 7.4619 (1.2); 7.4575 (1.2); 6.4378 (6.9); 6.4333 (6.9); 4.0334 (2.2); 4.0155 (6.9); 3.9974 (7.0); 3.9795 (2.2); 3.3131 (34.6); 2.8982 (8.5); 2.7392 (7.5); 2.5132 (9.1); 2.5088 (12.4); 2.5044 (9.2); 1.2608 (7.4); 1.2429 (16.0); 1.2249 (7.3)</p>
<p><b>L24: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 8.3869 (2.2); 8.3686 (2.2); 7.6945 (2.4); 7.6882 (2.4); 7.6079 (0.4); 7.6017 (0.4); 7.5916 (0.5); 7.5851 (0.5); 7.5763 (2.8); 7.5708 (1.0); 7.5578 (2.4); 7.5202 (0.7); 7.4947 (0.7); 7.4876 (0.8); 7.4620 (0.8); 7.4561 (0.4); 7.4304 (0.4); 7.2985 (5.3); 7.0485 (1.0); 6.5352 (2.7); 6.5289 (2.6); 3.9382 (16.0); 2.6265 (11.2); 1.6379 (1.4); 0.0361 (5.7)</p>
<p><b>L25: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 8.0523 (0.9); 7.6202 (4.0); 7.6142 (3.5); 7.5603 (6.2); 7.5423 (3.0); 7.5126 (0.5); 7.4795 (1.1); 7.4723 (1.1); 7.4513 (0.9); 7.3868 (1.0); 7.3556 (4.2); 7.3374 (3.1); 7.3260 (1.6); 7.3027 (3.8); 7.2982 (9.4); 7.2754 (0.4); 7.2342 (3.3); 7.2161 (3.0); 7.0415 (0.4); 7.0237 (0.4); 7.0054 (0.4); 6.9973 (0.4); 6.3931 (4.0); 6.3870 (3.4); 5.6503 (2.3); 4.2589 (0.4); 4.2330 (1.6); 4.2086 (4.3); 4.1845 (4.3); 4.1605 (1.4); 2.9925 (6.2); 2.9200 (5.4); 2.9188 (5.5); 2.6791 (16.0); 1.7284 (1.5); 1.6889 (4.4); 1.5799 (0.4); 1.5556 (0.8); 1.5311 (0.4); 1.4339 (4.5); 1.4099 (9.3); 1.3858 (4.3); 0.0352 (9.8)</p>
<p><b>L26: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 8.4105 (3.0); 8.3922 (3.2); 8.0531 (0.6); 7.7300 (3.2); 7.7239 (3.2); 7.6127 (0.6); 7.6065 (0.6); 7.5965 (0.7); 7.5900 (0.7); 7.5815 (1.2); 7.5749 (4.0); 7.5655 (1.2); 7.5567 (3.2); 7.5208 (1.0); 7.4953 (1.0); 7.4884 (1.3); 7.4628 (1.2); 7.4570 (0.7); 7.4308 (0.6); 7.2984 (8.6); 7.0162 (1.6); 6.5170 (3.5); 6.5109 (3.4); 4.2669 (1.3); 4.2428 (4.3); 4.2188 (4.3); 4.1948 (1.4); 2.9935 (5.4); 2.9206 (4.8); 2.5967 (16.0); 1.6462 (4.9); 1.4738 (4.5); 1.4497 (9.4); 1.4257 (4.4); 0.0355 (9.0)</p>
<p><b>L27: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 10.3253 (4.3); 8.5370 (2.7); 8.5208 (2.8); 7.7951 (3.3); 7.7891 (3.3); 7.6869 (0.6); 7.6804 (0.6); 7.6708 (0.7); 7.6642 (0.7); 7.6557 (1.0); 7.6493 (1.0); 7.6397 (1.0); 7.6332 (0.9); 7.5650 (0.9); 7.5387 (1.0); 7.5329 (1.3); 7.5069 (1.2); 7.4747 (0.6); 7.2985 (9.5); 7.2781 (2.6); 6.9713 (2.0); 6.5321 (3.5); 6.5261 (3.4); 4.0359 (2.6); 4.0123 (4.1); 3.9882 (2.7); 2.4886 (16.0); 1.8381 (1.4); 1.8138 (2.7); 1.7897 (2.7); 1.7654 (1.5); 1.7408 (0.3); 1.6409 (8.4); 1.2898 (0.3); 0.8072 (4.4); 0.7826 (8.9); 0.7579 (4.0); 0.0456 (0.4); 0.0366 (8.1); 0.0348 (11.6); 0.0240 (0.4)</p>

[0475]

<p><b>I.28: <sup>1</sup>H-NMR(300.1 MHz, d6-DMSO):</b></p> <p><math>\delta</math>= 8.4029 (5.8); 8.3052 (5.6); 7.9041 (4.7); 7.6222 (6.0); 7.5925 (2.3); 7.5700 (2.6); 7.5364 (1.8); 7.5071 (1.5); 7.4781 (0.5); 7.3179 (5.4); 6.3761 (5.4); 3.9330 (1.8); 3.3511 (26.6); 2.6069 (16.0); 2.5056 (10.0); 2.0787 (0.8); 1.2552 (4.5); 1.2323 (8.7); 1.2092 (4.2); -0.0043 (0.4)</p>
<p><b>I.29: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p><math>\delta</math>= 8.1801 (2.1); 8.1608 (2.1); 8.0129 (2.4); 7.7529 (2.8); 7.7467 (2.8); 7.5769 (0.5); 7.5712 (0.5); 7.5597 (0.6); 7.5537 (0.6); 7.5463 (0.9); 7.5407 (1.0); 7.5292 (0.8); 7.5234 (0.9); 7.4947 (0.8); 7.4724 (0.8); 7.4631 (1.1); 7.4408 (1.1); 7.4324 (0.6); 7.4095 (0.6); 7.2988 (5.6); 6.6564 (2.6); 6.6371 (2.6); 6.5270 (3.0); 6.5208 (3.0); 6.0534 (1.6); 4.1652 (0.7); 4.1414 (0.7); 3.8751 (16.0); 3.8623 (0.5); 2.6360 (12.9); 2.0786 (3.0); 1.6920 (2.4); 1.3162 (1.2); 1.2924 (2.8); 1.2686 (0.9); 0.9357 (0.5); 0.9141 (1.6); 0.8908 (0.6); 0.0325 (5.6)</p>
<p><b>I.30: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p><math>\delta</math>= 10.0511 (1.7); 8.2809 (1.7); 7.8286 (1.2); 7.8225 (1.2); 7.6541 (0.3); 7.6474 (0.3); 7.5253 (0.4); 7.4994 (0.4); 7.2984 (6.0); 6.9536 (0.6); 6.4748 (1.3); 6.4686 (1.2); 5.3361 (0.9); 4.0264 (0.6); 4.0021 (0.6); 3.9906 (0.8); 3.9811 (6.3); 3.9668 (0.7); 2.4422 (5.2); 1.6231 (16.0); 1.3881 (1.6); 1.3640 (3.3); 1.3399 (1.5); 0.0363 (7.0)</p>
<p><b>I.31: <sup>1</sup>H-NMR(300.1 MHz, d6-DMSO):</b></p> <p><math>\delta</math>= 8.3918 (5.9); 8.2963 (5.7); 7.8789 (4.7); 7.6542 (5.3); 7.6096 (2.1); 7.5902 (1.9); 7.5456 (1.7); 7.5163 (1.5); 7.4865 (0.5); 7.3288 (5.3); 6.4170 (5.3); 3.8608 (3.5); 3.3520 (11.5); 2.6121 (16.0); 2.5097 (7.6); 1.6360 (2.1); 0.7266 (4.5); 0.7022 (8.5); 0.6780 (4.0); -0.0013 (0.3)</p>
<p><b>I.32: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p><math>\delta</math>= 10.2909 (0.6); 8.5595 (0.7); 7.8609 (0.4); 7.8547 (0.4); 7.2989 (8.8); 6.5279 (0.5); 6.5217 (0.4); 2.6829 (0.4); 2.4096 (1.8); 1.5941 (16.0); 1.3917 (0.6); 1.3676 (1.2); 1.3434 (0.6); 0.0480 (0.6); 0.0372 (11.4); 0.0263 (0.4)</p>
<p><b>I.33: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p><math>\delta</math>= 10.0635 (4.2); 8.2792 (4.4); 7.8276 (3.0); 7.8215 (2.9); 7.6862 (0.6); 7.6795 (0.5); 7.6701 (0.6); 7.6633 (0.6); 7.6551 (0.8); 7.6484 (0.8); 7.6390 (0.8); 7.6322 (0.8); 7.5584 (0.7); 7.5325 (0.8); 7.5257 (0.9); 7.4999 (0.9); 7.4941 (0.5); 7.4680 (0.4); 7.2990 (8.3); 6.9854 (1.4); 6.4779 (3.2); 6.4718 (3.1); 4.0417 (0.5); 4.0203 (0.6); 4.0167 (0.5); 3.9959 (1.2); 3.9763 (16.0); 3.9500 (0.8); 3.8876 (0.7); 3.8631 (1.3); 3.8551 (0.5); 3.8389 (0.8); 3.8176 (0.7); 3.7935 (0.4); 2.4417 (12.3); 1.8282 (0.6); 1.8136 (0.6); 1.8038 (1.1); 1.7891 (0.9); 1.7792 (1.1); 1.7676 (0.9); 1.7546 (0.6); 1.7431 (0.6); 1.6608 (7.3); 0.7963 (3.6); 0.7716 (7.5); 0.7469 (3.2); 0.0456 (0.4); 0.0348 (10.4)</p>
<p><b>I.34: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p><math>\delta</math>= 8.1934 (2.5); 8.1742 (2.5); 7.9810 (2.8); 7.7877 (3.4); 7.7815 (3.5); 7.5743 (0.5); 7.5687 (0.5); 7.5570 (0.6); 7.5511 (0.6); 7.5436 (1.0); 7.5381 (1.1); 7.5265 (1.0); 7.5207 (1.0); 7.4957 (1.0); 7.4734 (0.9); 7.4641 (1.3); 7.4417 (1.2); 7.4333 (0.5); 7.4107 (0.5); 7.2988 (13.1); 6.6737 (3.2); 6.6544 (3.2); 6.4967 (3.6); 6.4905 (3.7); 5.9969 (1.9); 4.1369 (0.4); 4.1131 (0.8); 4.0914 (1.2); 4.0678 (1.8); 4.0443 (1.0); 4.0353 (0.9); 4.0107 (1.9); 3.9861 (1.0); 3.9655 (0.8); 3.9407 (0.4); 2.6309 (16.0); 1.9646 (1.4); 1.9400 (2.8); 1.9156 (2.9); 1.8912 (1.5); 1.8669 (0.3); 1.6211 (11.6); 0.9553 (4.4); 0.9307 (9.0); 0.9060 (4.0); 0.0469 (0.5); 0.0360 (13.9); 0.0251 (0.4)</p>
<p><b>I.35: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p><math>\delta</math>= 10.2920 (1.4); 8.5579 (1.5); 7.8575 (0.9); 7.8513 (0.9); 7.2990 (9.7); 6.8584 (0.4); 6.5332 (1.0); 6.5270 (1.0); 4.0324 (0.4); 4.0098 (0.4); 3.8791 (0.4); 2.4189 (4.1); 1.8049 (0.6); 1.7803 (0.7); 1.7560 (0.4); 1.5974 (16.0); 0.8036 (1.2); 0.7791 (2.4); 0.7543 (1.0); 0.0478 (0.4); 0.0370 (12.9); 0.0261 (0.4)</p>
<p><b>IIa.01: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p><math>\delta</math>= 8.3889 (1.2); 8.3812 (1.3); 8.3747 (1.4); 8.3670 (1.3); 7.6629 (2.8); 7.5117 (0.6); 7.5063 (0.6); 7.4947 (0.7); 7.4884 (0.7); 7.4814 (1.1); 7.4759 (1.2); 7.4641 (1.0); 7.4582 (1.0); 7.4304 (1.0); 7.4079 (1.0); 7.3985 (1.2); 7.3759 (1.2); 7.3678 (0.6); 7.3448 (0.5); 7.3224 (0.4); 7.3150 (0.6); 7.2987 (11.6); 7.2886 (4.7); 7.2737 (2.4); 7.2630 (0.5); 7.2485 (0.6); 4.2688 (7.4); 2.7710 (16.0); 2.5903 (0.5); 2.0827 (0.8); 1.6187 (10.6); 1.2961 (0.6); 0.0465 (0.4); 0.0358 (11.7)</p>

[0476]

<p><b>IIa.02:</b> <math>^1\text{H-NMR}</math>(300.2 MHz, <math>\text{CDCl}_3</math>):</p> <p><math>\delta</math>= 8.9703 (1.9); 8.9618 (2.0); 8.5345 (1.3); 8.5285 (1.4); 8.5187 (1.4); 8.5128 (1.4); 8.2507 (1.3); 8.2451 (1.6); 8.2426 (1.5); 8.2373 (1.3); 8.1976 (1.4); 8.1916 (1.4); 8.1714 (1.6); 8.1654 (1.5); 7.6539 (0.6); 7.6497 (0.7); 7.6265 (1.6); 7.6219 (1.5); 7.6040 (0.8); 7.5888 (0.8); 7.5791 (1.1); 7.5633 (1.0); 7.5518 (0.5); 7.5360 (0.5); 7.5150 (1.6); 7.4992 (1.5); 7.4890 (2.0); 7.4847 (1.0); 7.4730 (1.4); 7.4651 (0.6); 7.4595 (0.6); 7.4556 (0.9); 7.4507 (0.8); 7.4302 (0.6); 7.4254 (0.5); 7.2993 (3.1); 3.3933 (16.0); 3.1379 (0.7); 2.0794 (0.8); 1.6601 (3.6); 1.3171 (0.3); 1.2933 (0.8); 0.9159 (0.3); 0.1062 (4.2); 0.0342 (2.5)</p>
<p><b>IIc.01:</b> <math>^1\text{H-NMR}</math>(300.2 MHz, <math>\text{CDCl}_3</math>):</p> <p><math>\delta</math>= 10.2243 (1.7); 8.3468 (1.2); 8.3294 (1.2); 7.6622 (0.4); 7.6555 (0.4); 7.6460 (0.4); 7.6393 (0.3); 7.5512 (0.3); 7.5449 (0.4); 7.5192 (0.4); 7.4747 (1.1); 7.4573 (1.0); 7.3471 (0.4); 7.2984 (6.8); 2.9035 (5.7); 1.6177 (16.0); 0.0355 (5.7)</p>
<p><b>III.f.01:</b> <math>^1\text{H-NMR}</math>(300.2 MHz, <math>\text{CDCl}_3</math>):</p> <p><math>\delta</math>= 8.9361 (4.1); 8.9291 (4.1); 7.9686 (3.6); 7.6015 (1.8); 7.5773 (3.3); 7.5739 (3.1); 7.5359 (1.6); 7.5198 (1.6); 7.5105 (2.6); 7.4942 (2.5); 7.4835 (1.5); 7.4671 (1.4); 7.4385 (2.0); 7.4335 (1.9); 7.4132 (1.2); 7.4081 (1.4); 7.4034 (2.0); 7.3988 (2.0); 7.3778 (1.5); 7.3699 (5.3); 7.3585 (5.4); 7.2987 (7.4); 6.9904 (3.8); 6.9791 (3.5); 4.1919 (12.3); 1.6749 (16.0); 0.0461 (0.4); 0.0354 (9.1); 0.0245 (0.4)</p>
<p><b>III.f.02:</b> <math>^1\text{H-NMR}</math>(300.2 MHz, <math>\text{CDCl}_3</math>):</p> <p><math>\delta</math>= 7.7351 (2.4); 7.5225 (0.6); 7.5163 (0.6); 7.5052 (0.6); 7.4987 (0.7); 7.4922 (1.0); 7.4860 (1.0); 7.4749 (0.9); 7.4685 (1.0); 7.4102 (3.3); 7.3988 (3.2); 7.3899 (1.0); 7.3804 (1.1); 7.3575 (1.1); 7.3498 (0.6); 7.3266 (0.6); 7.2989 (4.0); 6.8120 (2.0); 6.8037 (1.2); 6.8007 (2.0); 4.1076 (6.6); 2.7800 (16.0); 1.6670 (4.0); 0.0356 (4.9)</p>
<p><b>IXe.01:</b> <math>^1\text{H-NMR}</math>(499.9 MHz, <math>\text{CDCl}_3</math>):</p> <p><math>\delta</math>= 7.5472 (2.6); 7.5435 (2.7); 7.4385 (2.7); 7.4277 (3.0); 7.2619 (3.2); 7.1106 (2.8); 7.0999 (2.8); 6.4286 (2.9); 6.4249 (2.9); 3.9768 (0.6); 3.9420 (0.4); 3.8442 (16.0); 1.6128 (4.4); -0.0002 (2.8)</p>
<p><b>IXe.02:</b> <math>^1\text{H-NMR}</math>(300.2 MHz, <math>\text{CDCl}_3</math>):</p> <p><math>\delta</math>= 7.6207 (4.4); 7.6144 (4.4); 7.5535 (0.3); 7.4837 (5.4); 7.4658 (6.0); 7.3461 (0.3); 7.3414 (0.3); 7.2991 (4.6); 7.1479 (6.1); 7.1300 (5.4); 7.0818 (0.4); 7.0772 (0.3); 6.4376 (5.2); 6.4313 (5.1); 4.3197 (0.4); 4.2955 (0.4); 4.1924 (2.3); 4.1683 (7.3); 4.1441 (7.4); 4.1200 (2.4); 1.6725 (4.3); 1.5568 (0.6); 1.5180 (0.5); 1.4939 (1.0); 1.4685 (8.0); 1.4444 (16.0); 1.4202 (7.5); 0.0369 (4.3)</p>
<p><b>IXa.01:</b> <math>^1\text{H-NMR}</math>(400.1 MHz, <math>\text{CDCl}_3</math>):</p> <p><math>\delta</math>= 8.6603 (1.3); 8.6568 (1.4); 8.6487 (1.4); 8.6453 (1.4); 8.0339 (1.4); 8.0304 (1.4); 8.0136 (1.5); 8.0101 (1.5); 7.5524 (2.3); 7.5476 (2.4); 7.2603 (6.2); 7.2202 (1.4); 7.2086 (1.4); 7.1999 (1.3); 7.1883 (1.3); 6.6374 (2.6); 6.6325 (2.6); 3.9031 (16.0); 1.5743 (10.7); -0.0002 (6.4)</p>
<p><b>IXc.01:</b> <math>^1\text{H-NMR}</math>(300.2 MHz, <math>\text{CDCl}_3</math>):</p> <p><math>\delta</math>= 8.7771 (6.4); 8.6269 (4.6); 8.6106 (4.7); 7.6523 (4.4); 7.6460 (4.7); 7.3148 (4.0); 7.3130 (3.6); 7.3063 (0.5); 7.2987 (13.1); 6.3839 (5.2); 6.3776 (5.4); 6.3704 (0.5); 4.1152 (0.5); 4.0943 (2.4); 4.0702 (7.2); 4.0461 (7.2); 4.0221 (2.4); 1.6654 (8.1); 1.4325 (7.8); 1.4084 (16.0); 1.3843 (7.5); 1.3068 (0.7); 1.2904 (0.6); 0.0452 (0.4); 0.0344 (11.8); 0.0283 (0.5); 0.0267 (0.4); 0.0251 (0.4); 0.0236 (0.5)</p>
<p><b>XIc.01:</b> <math>^1\text{H-NMR}</math>(300.2 MHz, <math>\text{CDCl}_3</math>):</p> <p><math>\delta</math>= 8.2394 (6.0); 8.1193 (4.1); 8.1030 (4.2); 7.6598 (5.5); 7.6538 (5.6); 7.2991 (14.6); 7.0391 (3.9); 7.0229 (3.8); 6.3646 (5.6); 6.3586 (5.5); 5.3363 (2.4); 4.1690 (0.6); 4.1451 (0.7); 4.0310 (5.2); 4.0072 (7.1); 3.9829 (5.3); 3.8323 (3.4); 3.7525 (1.3); 2.0814 (2.9); 1.8702 (0.7); 1.8456 (2.7); 1.8211 (4.9); 1.7969 (4.9); 1.7726 (2.8); 1.7482 (0.8); 1.6819 (6.2); 1.3188 (0.9); 1.3076 (0.4); 1.2951 (1.8); 1.2790 (1.0); 1.2713 (0.9); 0.8478 (8.2); 0.8232 (16.0); 0.7984 (7.3); 0.0456 (0.8); 0.0348 (17.5); 0.0240 (0.8)</p>

[0477]

<p><b>XIc.02: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 7.9317 (4.6); 7.8382 (4.4); 7.6884 (2.5); 7.6822 (2.5); 7.2990 (3.7); 6.6469 (0.4); 6.6190 (0.4); 6.3132 (2.8); 6.3070 (2.7); 4.0155 (0.6); 4.0029 (0.6); 3.9913 (1.7); 3.9789 (1.7); 3.9670 (1.7); 3.9549 (1.7); 3.9428 (0.6); 3.9312 (0.7); 3.8667 (16.0); 3.8479 (0.7); 3.8163 (1.5); 3.7150 (2.3); 2.0798 (0.4); 1.7680 (6.6); 1.4014 (3.8); 1.3773 (7.9); 1.3531 (3.7); 0.0337 (4.8)</p>
<p><b>XIc.03: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 8.1365 (3.0); 8.1139 (3.0); 7.7106 (1.7); 7.7045 (1.7); 7.2986 (12.5); 6.3416 (1.9); 6.3354 (1.8); 4.0482 (0.5); 4.0306 (0.5); 4.0242 (1.2); 4.0066 (1.2); 3.9999 (1.2); 3.9826 (1.2); 3.9758 (0.5); 3.9587 (0.5); 3.8532 (0.9); 1.6030 (16.0); 1.4225 (2.8); 1.3984 (5.7); 1.3742 (2.7); 0.0476 (0.6); 0.0443 (0.5); 0.0368 (17.5); 0.0291 (0.5); 0.0275 (0.5); 0.0260 (0.6)</p>
<p><b>XIc.04: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 7.9274 (4.3); 7.8340 (4.2); 7.6806 (2.5); 7.6745 (2.5); 7.2990 (2.9); 6.3116 (2.7); 6.3055 (2.7); 5.3325 (3.3); 3.9585 (0.5); 3.9359 (0.9); 3.9128 (1.3); 3.8879 (1.5); 3.8606 (16.0); 3.8457 (1.5); 3.8383 (1.3); 3.8179 (2.0); 3.7931 (0.6); 3.7132 (0.3); 1.8340 (0.7); 1.8295 (0.7); 1.8090 (1.4); 1.8043 (1.5); 1.7993 (8.1); 1.7845 (1.5); 1.7598 (0.8); 1.2772 (0.5); 0.8518 (3.5); 0.8271 (7.2); 0.8023 (3.2); 0.0318 (3.9)</p>
<p><b>XIc.05: <sup>1</sup>H-NMR(300.2 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</b></p> <p>δ= 8.1359 (3.8); 8.1125 (3.7); 7.7056 (2.0); 7.6994 (2.1); 7.2995 (11.4); 6.3488 (2.2); 6.3426 (2.3); 5.3387 (1.4); 3.9876 (0.5); 3.9656 (0.8); 3.9420 (1.5); 3.9245 (0.8); 3.9184 (0.9); 3.9002 (1.6); 3.8757 (1.3); 3.8549 (1.8); 3.8307 (0.5); 1.8521 (1.1); 1.8276 (2.2); 1.8032 (2.2); 1.7789 (1.1); 1.6106 (16.0); 1.3095 (0.4); 1.2805 (0.9); 0.8787 (3.1); 0.8541 (6.0); 0.8293 (2.7); 0.0480 (0.7); 0.0373 (15.0); 0.0265 (0.6)</p>

[0478] 用途实施例

[0479] 实施例A:对稻梨孢(*Pyricularia oryzae*)的体外细胞试验

[0480] 溶剂: 二甲基亚砷

[0481] 培养基: 14.6g无水D-葡萄糖(VWR),

[0482] 7.1g真菌学蛋白胨(Oxoid),

[0483] 1.4g颗粒状酵母提取物(Merck),QSP 1升

[0484] 接种体: 孢子悬浮液

[0485] 将试验化合物溶于二甲基亚砷中,并使用该溶液制备所需浓度范围的溶液。试验中使用的二甲基亚砷的最终浓度≤1%。

[0486] 制备稻梨孢的孢子悬浮液并稀释至所需的孢子密度。

[0487] 评估化合物在液体培养试验中抑制孢子萌发和菌丝生长的能力。将化合物以所需浓度加入到具有孢子的培养基中。温育5天后,通过菌丝生长的光谱测量来测定化合物的真菌毒性。通过比较含有试验化合物的孔中的吸光度值与没有试验化合物的对照孔中的吸光度来确定对真菌生长的抑制。

[0488] 在该试验中,本发明的以下化合物在20ppm的试验化合物浓度下显示出70%至79%的功效:I.04、I.16、I.18、I.24、I.29。

[0489] 在该试验中,本发明的以下化合物在20ppm的试验化合物浓度下显示出80%至89%的功效:I.06、I.07、I.13、I.15、I.22、I.26。

[0490] 在该试验中,本发明的以下化合物在20ppm的试验化合物浓度下显示出90%至100%的功效:I.05、I.12、I.20、I.25。

[0491] 实施例B:对菜豆炭疽菌(*Colletotrichum lindemuthianum*)的体外细胞试验

[0492] 溶剂: 二甲基亚砷

[0493] 培养基: 14.6g无水D-葡萄糖(VWR),

[0494] 7.1g真菌学蛋白胨(Oxoid),

- [0495] 1.4g颗粒状酵母提取物(Merck),QSP 1升
- [0496] 接种体: 孢子悬浮液
- [0497] 将试验化合物溶于二甲基亚砷中,并使用该溶液制备所需浓度范围的溶液。试验中使用的二甲基亚砷的最终浓度 $\leq 1\%$ 。
- [0498] 制备菜豆炭疽菌的孢子悬浮液并稀释至所需的孢子密度。
- [0499] 评估化合物在液体培养试验中抑制孢子萌发和菌丝生长的能力。将化合物以所需浓度加入到具有孢子的培养基中。温育6天后,通过菌丝生长的光谱测量来测定化合物的真菌毒性。通过比较含有试验化合物的孔中的吸光度值与没有试验化合物的对照孔中的吸光度来确定对真菌生长的抑制。
- [0500] 在该试验中,本发明的以下化合物在20ppm的试验化合物浓度下显示出70%至79%的功效:I.18。
- [0501] 在该试验中,本发明的以下化合物在20ppm的试验化合物浓度下显示出80%至89%的功效:I.03、I.16、I.23、I.29、I.32。
- [0502] 在该试验中,本发明的以下化合物在20ppm的试验化合物浓度下显示出90%至100%的功效:I.02、I.04、I.05、I.06、I.07、I.10、I.11、I.12、I.13、I.19、I.20、I.21、I.22、I.24、I.25、I.26、I.27、I.34。
- [0503] 实施例C:对颖枯小球腔菌(Leptnosphaeria nodorum)的体外细胞试验
- [0504] 溶剂: 二甲基亚砷
- [0505] 培养基: 14.6g无水D-葡萄糖(VWR),
- [0506] 7.1g真菌学蛋白胨(Oxoid),
- [0507] 1.4g颗粒状酵母提取物(Merck),QSP 1升
- [0508] 接种体: 孢子悬浮液
- [0509] 将试验化合物溶于二甲基亚砷中,并使用该溶液制备所需浓度范围的溶液。试验中使用的二甲基亚砷的最终浓度 $\leq 1\%$ 。
- [0510] 制备颖枯小球腔菌的孢子悬浮液并稀释至所需的孢子密度。
- [0511] 评估化合物在液体培养试验中抑制孢子萌发和菌丝生长的能力。将化合物以所需浓度加入到具有孢子的培养基中。温育6天后,通过菌丝生长的光谱测量来测定化合物的真菌毒性。通过比较含有试验化合物的孔中的吸光度值与没有试验化合物的对照孔中的吸光度来确定对真菌生长的抑制。
- [0512] 在该试验中,本发明的以下化合物在20ppm的试验化合物浓度下显示出70%至79%的功效:I.02、I.34。
- [0513] 在该试验中,本发明的以下化合物在20ppm的试验化合物浓度下显示出80%至89%的功效:I.04、I.09、I.12、I.16、I.17、I.19、I.20、I.29。
- [0514] 在该试验中,本发明的以下化合物在20ppm的试验化合物浓度下显示出90%至100%的功效:I.03、I.05、I.06、I.07、I.11、I.13、I.21、I.22、I.23、I.24、I.25、I.26。
- [0515] 实施例D:对灰葡萄孢(Botrytis cinerea) (灰霉(grey mould))的体内预防性试验
- [0516] 溶剂: 5体积% 的二甲基亚砷
- [0517] 10体积% 的丙酮

[0518] 乳化剂: 1 $\mu$ L 的**Tween®** 80/mg的活性成分

[0519] 使待测化合物在二甲基亚砜/丙酮//**Tween®** 80的混合物中溶解并均质化,然后在水中稀释至所需浓度。

[0520] 通过喷洒如上所述制备的试验化合物处理小黄瓜或甘蓝的幼苗。对照植物仅用丙酮/二甲基亚砜/**Tween®** 80的水溶液处理。

[0521] 在24小时后,通过用灰葡萄孢孢子的水悬浮液喷洒叶片来侵染植物。将被侵染的小黄瓜植株在17°C和90%的相对湿度下温育4至5天。将被侵染的甘蓝植株在20°C和100%的相对湿度下温育4至5天。

[0522] 接种4至5天后对试验进行评估。0%意指相当于对照植物的功效的功效,而100%的功效意指没有观察到病害。

[0523] 在该试验中,本发明的以下化合物在500ppm的试验化合物浓度下显示出70%至79%的功效:I.22。

[0524] 在该试验中,本发明的以下化合物在500ppm的试验化合物浓度下显示出80%至89%的功效:I.24.。

[0525] 在该试验中,本发明的以下化合物在500ppm的试验化合物浓度下显示出90%至100%的功效:I.09、I.10、I.16、I.17、I.19、I.21、I.27、I.30、I.32、I.33、I.35。