



# (12)发明专利申请

(10)申请公布号 CN 110506040 A

(43)申请公布日 2019.11.26

(21)申请号 201880023030.0

(22)申请日 2018.03.29

(30)优先权数据

201711012036 2017.04.03 IN

(85)PCT国际申请进入国家阶段日

2019.09.27

(86)PCT国际申请的申请数据

PCT/EP2018/058208 2018.03.29

(87)PCT国际申请的公布数据

WO2018/185013 EN 2018.10.11

(71)申请人 先正达参股股份有限公司

地址 瑞士巴塞尔

(72)发明人 T·J·霍夫曼 D·斯狄尔利

R·比奥德格尼斯 T·皮特纳

R·拉詹

(74)专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商标事务所 11038

代理人 张敏

(51)Int.Cl.

G07D 271/06(2006.01)

A01N 43/836(2006.01)

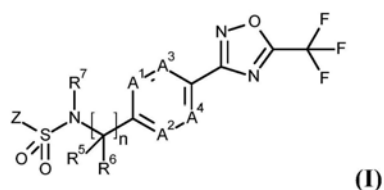
权利要求书4页 说明书136页

(54)发明名称

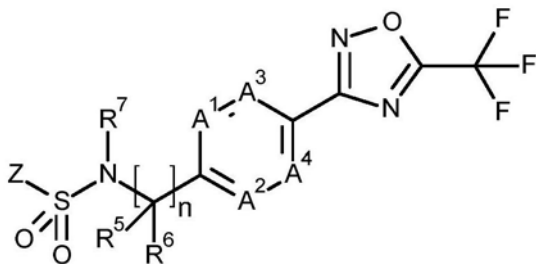
杀微生物的噁二唑衍生物

(57)摘要

具有式(I)的化合物,其中所述取代基是如在权利要求1中所定义的,所述化合物作为杀有害生物剂、尤其作为杀真菌剂是有用的。



1. 一种具有式 (I) 的化合物:



(I)

其中

n是0、1、或2;

A<sup>1</sup>表示N或CR<sup>1</sup>,其中R<sup>1</sup>表示氢、卤素或甲基;

A<sup>2</sup>表示N或CR<sup>2</sup>,其中R<sup>2</sup>表示氢、卤素或甲基;

A<sup>3</sup>表示N或CR<sup>3</sup>,其中R<sup>3</sup>表示氢或氟;

A<sup>4</sup>表示N或CR<sup>4</sup>,其中R<sup>4</sup>表示氢或氟;并且

其中A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>和A<sup>4</sup>中的至少2个是C-H;

R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>独立地表示氢、甲基、氰基、二氟甲基或三氟甲基;

R<sup>7</sup>表示氢、羟基、C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>卤代烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基、羟基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基、C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>3-4</sub>烯基、C<sub>3-4</sub>炔基、C<sub>3-4</sub>烯基氧基、C<sub>3-4</sub>炔基氧基、C<sub>1-4</sub>烷基羰基氧基、C<sub>3-6</sub>环烷基或C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基;

Z表示R<sup>8</sup>,其中

R<sup>8</sup>是C<sub>1-6</sub>烷基、C<sub>2-6</sub>烯基、C<sub>2-6</sub>炔基、氰基C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>卤代烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷基羰基氧基C<sub>2-4</sub>烷基、N-C<sub>1-4</sub>烷基氨基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、N,N-二C<sub>1-4</sub>烷基氨基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、N-C<sub>1-4</sub>烷基氨基C<sub>2-5</sub>烷基、N,N-二C<sub>1-4</sub>烷基氨基C<sub>2-5</sub>烷基、C<sub>1-3</sub>烷基羰基氨基C<sub>2-5</sub>烷基、或C<sub>1-4</sub>烷氧基羰基氨基C<sub>2-5</sub>烷基;或者

R<sup>8</sup>是C<sub>3-6</sub>环烷基;C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基;苯基;苯基C<sub>1-2</sub>烷基;杂芳基或杂芳基C<sub>1-2</sub>烷基,其中所述杂芳基部分是包含1、2、3或4个单独地选自N、O和S的杂原子的5元或6元单环芳香族环;杂环基;或杂环基C<sub>1-2</sub>烷基,其中所述杂环基部分是包含1或2个单独地选自N、O和S的杂原子的4元至6元非芳香族环;

其中当R<sup>8</sup>是C<sub>3-6</sub>环烷基、C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基、苯基、苯基C<sub>1-2</sub>烷基、杂芳基、杂芳基C<sub>1-2</sub>烷基、杂环基、或杂环基C<sub>1-2</sub>烷基时,所述C<sub>3-6</sub>环烷基、苯基、杂芳基、或杂环基基序任选地被1或2个取代基取代,所述取代基可以相同或不同,选自R<sup>9</sup>;

R<sup>9</sup>表示氰基、氟、氯、溴、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、或二氟甲氧基;并且其中当R<sup>8</sup>是被取代的C<sub>3-6</sub>环烷基或杂环基时,这些环可以含有羰基(C=O)或磺酰基(S(O)<sub>2</sub>)基团;或者

Z表示-N(R<sup>10</sup>)R<sup>11</sup>,其中

R<sup>10</sup>表示氢、C<sub>1-6</sub>烷基、C<sub>1-6</sub>卤代烷基、氰基C<sub>1-4</sub>烷基、羟基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>3-6</sub>烯基、C<sub>3-6</sub>炔基、氨基C<sub>2-4</sub>烷基、N-C<sub>1-4</sub>烷基氨基C<sub>2-4</sub>烷基、N,N-二C<sub>1-4</sub>烷基氨基C<sub>2-4</sub>烷基、甲酰基、C<sub>1-4</sub>烷基羰基、C<sub>1-4</sub>烷基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、

C<sub>1-4</sub>烷基羰基氧基C<sub>1-4</sub>烷基、N-C<sub>1-4</sub>烷基氨基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、N,N-二C<sub>1-4</sub>烷基氨基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基羰基氨基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷基羰基氨基C<sub>2-4</sub>烷基、或C<sub>1-4</sub>卤代烷基羰基氨基C<sub>2-4</sub>烷基；或者

R<sup>10</sup>是C<sub>3-6</sub>环烷基；C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基；苯基；苯基C<sub>1-2</sub>烷基；杂芳基或杂芳基C<sub>1-2</sub>烷基，其中所述杂芳基部分是包含1、2、3或4个单独地选自N、O和S的杂原子的5元或6元单环芳香族环；杂环基；或杂环基C<sub>1-2</sub>烷基，其中所述杂环基部分是包含1或2个单独地选自N、O和S的杂原子的4元至6元非芳香族环；

其中当R<sup>10</sup>是C<sub>3-6</sub>环烷基、C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基、苯基C<sub>1-2</sub>烷基、苯基、杂芳基、杂芳基C<sub>1-2</sub>烷基、杂环基、或杂环基C<sub>1-2</sub>烷基时，所述C<sub>3-6</sub>环烷基、苯基、杂芳基、或杂环基基序任选地被1或2个取代基取代，所述取代基可以相同或不同，选自R<sup>12</sup>；

R<sup>12</sup>表示氰基、氟、氯、溴、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、或二氟甲氧基；并且其中当R<sup>10</sup>是被取代的C<sub>3-6</sub>环烷基或杂环基时，这些环可以含有羰基(C=O)或磺酰基(S(O)<sub>2</sub>)基团；

R<sup>11</sup>表示氢、羟基、C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>卤代烷基、C<sub>3-4</sub>烯基、C<sub>3-4</sub>炔基、C<sub>3-4</sub>环烷基、C<sub>3-4</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基、C<sub>3-4</sub>烯基氧基、或C<sub>3-4</sub>炔基氧基；或者

其盐或N-氧化物。

2. 根据权利要求1所述的化合物，其中A<sup>1</sup>和A<sup>2</sup>各自独立地表示N、C-H或C-F，并且A<sup>3</sup>和A<sup>4</sup>各自独立地表示C-H或C-F，其中A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>和A<sup>4</sup>中的至少2个是C-H。

3. 根据权利要求1或权利要求2所述的化合物，其中R<sup>7</sup>是氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基、环丙基或环丙基甲基。

4. 根据权利要求1至3中任一项所述的化合物，其中R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>独立地表示氢或甲基。

5. 根据权利要求1至4中任一项所述的化合物，其中Z表示R<sup>8</sup>，其中R<sup>8</sup>是C<sub>1-6</sub>烷基、C<sub>2-6</sub>烯基、C<sub>2-6</sub>炔基、氧基C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>卤代烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、或C<sub>1-4</sub>烷基羰基氧基C<sub>2-4</sub>烷基；或者

R<sup>8</sup>是C<sub>3-6</sub>环烷基；C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基；苯基；苯基C<sub>1-2</sub>烷基；杂芳基或杂芳基C<sub>1-2</sub>烷基，其中所述杂芳基部分是包含1、2或3个单独地选自N、O和S的杂原子的5元或6元单环芳香族环；杂环基；或杂环基C<sub>1-2</sub>烷基，其中所述杂环基部分是包含1或2个单独地选自N、O和S的杂原子的4元至6元非芳香族环；

其中当R<sup>8</sup>是C<sub>3-6</sub>环烷基、C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基、苯基、苯基C<sub>1-2</sub>烷基、杂芳基、杂芳基C<sub>1-2</sub>烷基、杂环基、或杂环基C<sub>1-2</sub>烷基时，所述C<sub>3-6</sub>环烷基、苯基、杂芳基、或杂环基基序任选地被1或2个取代基取代，所述取代基可以相同或不同，选自R<sup>9</sup>；

R<sup>9</sup>表示氰基、氟、氯、溴、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、或二氟甲氧基；并且其中当R<sup>8</sup>是被取代的C<sub>3-6</sub>环烷基或杂环基时，这些环可以含有羰基(C=O)或磺酰基(S(O)<sub>2</sub>)基团。

6. 根据权利要求1至5中任一项所述的化合物，其中Z表示R<sup>8</sup>，其中R<sup>8</sup>是C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>2-4</sub>烯基、C<sub>2-4</sub>炔基、氧基C<sub>1-2</sub>烷基、C<sub>1-3</sub>卤代烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-3</sub>烷基羰基C<sub>1-3</sub>烷基、C<sub>1-3</sub>烷氧基羰基C<sub>1-3</sub>烷基、或C<sub>1-3</sub>烷基羰基氧基C<sub>2-4</sub>烷基；或者

R<sup>8</sup>是C<sub>3-5</sub>环烷基；C<sub>3-5</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基；苯基；苯基C<sub>1-2</sub>烷基；杂芳基或杂芳基C<sub>1-2</sub>烷基，其中所述杂芳基部分是包含1、2或3个单独地选自N、O和S的杂原子的5元或6元单环芳香族环；杂

环基;或杂环基 $C_{1-2}$ 烷基,其中所述杂环基部分是包含1或2个单独地选自N、O和S的杂原子的4元至6元非芳香族环;

其中当 $R^8$ 是 $C_{3-5}$ 环烷基、 $C_{3-5}$ 环烷基 $C_{1-2}$ 烷基、苯基、苯基 $C_{1-2}$ 烷基、杂芳基、杂芳基 $C_{1-2}$ 烷基、杂环基、或杂环基 $C_{1-2}$ 烷基时,所述 $C_{3-5}$ 环烷基、苯基、杂芳基、或杂环基基序任选地被1或2个取代基取代,所述取代基可以相同或不同,选自 $R^9$ ;

$R^9$ 表示氰基、氟、氯、溴、甲基、二氟甲基、三氟甲基或甲氧基;并且其中当 $R^8$ 是被取代的 $C_{3-5}$ 环烷基或杂环基时,这些环可以含有羰基(C=O)基团。

7. 根据权利要求1至6中任一项所述的化合物,其中Z表示 $R^8$ ,其中 $R^8$ 是 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{3-4}$ 烯基、 $C_{1-3}$ 卤代烷基、 $C_{1-2}$ 烷氧基 $C_{2-3}$ 烷基或 $C_{1-2}$ 烷氧基羰基 $C_{1-2}$ 烷基;或者

$R^8$ 是 $C_{3-5}$ 环烷基;(C<sub>3-5</sub>环烷基)甲基;苯基;苄基;杂芳基;(杂芳基)甲基,其中所述杂芳基部分是包含1或2个单独地选自N、O和S的杂原子的5元单环芳香族环;杂环基或(杂环基)甲基,其中所述杂环基部分是包含1或2个单独地选自N和O的杂原子的5元或6元非芳香族环;

其中当 $R^8$ 是 $C_{3-5}$ 环烷基、(C<sub>3-5</sub>环烷基)甲基、苯基、苄基、杂芳基、(杂芳基)甲基、杂环基、或(杂环基)甲基时,所述 $C_{3-5}$ 环烷基、苯基、杂芳基、或杂环基基序任选地被1或2个取代基取代,所述取代基可以相同或不同,选自 $R^9$ ;

$R^9$ 表示氰基、氟、氯、溴、甲基或甲氧基。

8. 根据权利要求1至7中任一项所述的化合物,其中Z表示 $R^8$ ,其中 $R^8$ 是甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、叔丁基、烯丙基、丙-1-烯基、异丙烯基、1,1-二氟甲基、1,1,1-三氟甲基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、3,3,3-三氟丙基、甲氧基甲基、甲氧基乙基、甲氧基羰基甲基、甲氧基羰基乙基、乙氧基羰基甲基、乙氧基羰基乙基、环丙基、环丁基、环戊基、环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基、2,2-二氟环丙基甲基、2,2-二氯环丙基甲基、苯基、苄基、2-氟苯基、2,4-二氟苯基、2,4-二氯苯基、4-氯-2-氟苯基、4-氟-2-氯苯基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、1-甲基吡啶-3-基、1-甲基吡啶-4-基、噻吩-2-基、噻吩-3-基、2-甲基噻吩-5-基、2-甲基噻吩-4-基、四氢呋喃-2-基、四氢呋喃-3-基、四氢呋喃-2-基甲基、四氢呋喃-3-基甲基、吗啉基、吡咯烷-1-基、吡咯烷-2-基、吡咯烷-3-基、哌啶-1-基、哌啶-2-基、哌啶-3-基、或哌啶-4-基。

9. 根据权利要求1至4中任一项所述的化合物,其中Z表示 $-N(R^{10})R^{11}$ ,其中 $R^{10}$ 表示氢、 $C_{1-6}$ 烷基、 $C_{1-6}$ 卤代烷基、氰基 $C_{1-4}$ 烷基、羟基 $C_{2-4}$ 烷基、 $C_{1-2}$ 烷氧基 $C_{2-4}$ 烷基、 $C_{1-2}$ 卤代烷氧基 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{3-6}$ 烯基、 $C_{3-6}$ 炔基、甲酰基、 $C_{1-4}$ 烷基羰基、 $C_{1-4}$ 烷基羰基 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 烷氧基羰基 $C_{1-4}$ 烷基、或 $C_{1-4}$ 烷基羰基氧基 $C_{1-4}$ 烷基;或者

$R^{10}$ 是 $C_{3-6}$ 环烷基、 $C_{3-6}$ 环烷基 $C_{1-2}$ 烷基、苯基、或苯基 $C_{1-2}$ 烷基;

其中当 $R^{10}$ 是 $C_{3-6}$ 环烷基、 $C_{3-6}$ 环烷基 $C_{1-2}$ 烷基、苯基、或苯基 $C_{1-2}$ 烷基时,所述 $C_{3-6}$ 环烷基或苯基基序任选地被1或2个取代基取代,所述取代基可以相同或不同,选自 $R^{12}$ ;

$R^{12}$ 表示氰基、氟、氯、溴、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、或二氟甲氧基;并且其中当 $R^{10}$ 是被取代的 $C_{3-6}$ 环烷基或杂环基时,这些环可以含有羰基(C=O)或磺酰基(S(O)<sub>2</sub>)基团;并且

$R^{11}$ 表示氢、羟基、 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-2}$ 卤代烷基、 $C_{3-4}$ 烯基、 $C_{3-4}$ 炔基、 $C_{3-4}$ 环烷基、 $C_{3-4}$ 环烷基 $C_{1-2}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 烷氧基、 $C_{3-4}$ 烯基氧基、或 $C_{3-4}$ 炔基氧基。

10. 根据权利要求1至4或权利要求9中任一项所述的化合物,其中Z表示 $-N(R^{10})R^{11}$ ,其中

R<sup>10</sup>是氢、C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>卤代烷基、氰基C<sub>1-2</sub>烷基、羟基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基C<sub>1-2</sub>烷基、C<sub>3-4</sub>烯基、C<sub>3-4</sub>炔基、甲酰基、C<sub>1-2</sub>烷基羰基、C<sub>1-2</sub>烷基羰基C<sub>1-2</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>烷氧基羰基C<sub>1-2</sub>烷基、或C<sub>1-2</sub>烷基羰基氧基C<sub>1-2</sub>烷基；或者

R<sup>10</sup>是C<sub>3-6</sub>环烷基或C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基；

其中当R<sup>10</sup>是C<sub>3-6</sub>环烷基或C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基时，所述C<sub>3-6</sub>环烷基基序任选地被1或2个取代基取代，所述取代基可以相同或不同，选自R<sup>12</sup>；

R<sup>12</sup>表示氰基、氟、氯、溴、甲基或甲氧基；并且其中当R<sup>10</sup>是被取代的C<sub>3-6</sub>环烷基或杂环基时，这些环可以含有羰基(C=O)基团；并且

R<sup>11</sup>表示氢、羟基、C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>卤代烷基、C<sub>3-4</sub>烯基、C<sub>3-4</sub>炔基、C<sub>3-4</sub>环烷基、C<sub>3-4</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基或C<sub>1-4</sub>烷氧基。

11. 根据权利要求1至10中任一项所述的化合物，其中n是0或1。

12. 一种农用化学组合物，所述农用化学组合物包含杀真菌有效量的根据权利要求1至11中任一项所述的具有式(I)的化合物。

13. 根据权利要求12所述的组合物，所述组合物进一步包含至少一种另外的活性成分和/或农用化学上可接受的稀释剂或载体。

14. 一种控制或预防植物病原性微生物侵染有用植物的方法，其中将杀真菌有效量的根据权利要求1至11中任一项所述的具有式(I)的化合物或包含此化合物作为活性成分的组合物施用于所述植物、其部分或其场所。

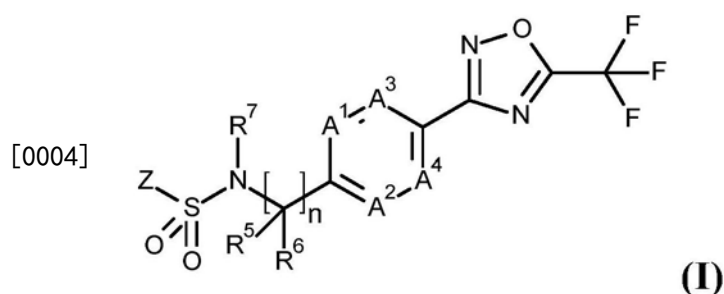
15. 根据权利要求1至11中任一项所述的具有式(I)的化合物作为杀真菌剂的用途。

## 杀微生物的噁二唑衍生物

[0001] 本发明涉及杀微生物的噁二唑衍生物,例如作为活性成分,这些噁二唑衍生物具有杀微生物活性,特别是杀真菌活性。本发明还涉及包含这些噁二唑衍生物中的至少一种的农用化学组合物,涉及这些化合物的制备方法,并且涉及这些噁二唑衍生物或组合物在农业或园艺中用于控制或预防植物、收获的粮食作物、种子或非生命材料被植物病原性微生物、优选真菌侵染的用途。

[0002] 作为杀昆虫剂和杀螨剂的某些噁二唑衍生物是例如从CN 1927860已知的。WO 2013/064079、EP 0 276 432和WO 2015/185485描述了取代的噁二唑用于防治植物病原性真菌的用途。

[0003] 根据本发明,提供了一种具有式(I)的化合物:



[0005] 其中

[0006] n是0、1、或2;

[0007] A<sup>1</sup>表示N或CR<sup>1</sup>,其中R<sup>1</sup>表示氢、卤素或甲基;

[0008] A<sup>2</sup>表示N或CR<sup>2</sup>,其中R<sup>2</sup>表示氢、卤素或甲基;

[0009] A<sup>3</sup>表示N或CR<sup>3</sup>,其中R<sup>3</sup>表示氢或氟;

[0010] A<sup>4</sup>表示N或CR<sup>4</sup>,其中R<sup>4</sup>表示氢或氟;并且

[0011] 其中A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>和A<sup>4</sup>中的至少2个是C-H;

[0012] R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>独立地表示氢、甲基、氰基、二氟甲基或三氟甲基;

[0013] R<sup>7</sup>表示氢、羟基、C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>卤代烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基、羟基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基、C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>3-4</sub>烯基、C<sub>3-4</sub>炔基、C<sub>3-4</sub>烯基氧基、C<sub>3-4</sub>炔基氧基、C<sub>1-4</sub>烷基羰基氧基、C<sub>3-6</sub>环烷基或C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基;

[0014] Z表示R<sup>8</sup>,其中

[0015] R<sup>8</sup>是C<sub>1-6</sub>烷基、C<sub>2-6</sub>烯基、C<sub>2-6</sub>炔基、氰基C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>卤代烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷基羰基氧基C<sub>2-4</sub>烷基、N-C<sub>1-4</sub>烷基氨基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、N,N-二C<sub>1-4</sub>烷基氨基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、N-C<sub>1-4</sub>烷基氨基C<sub>2-5</sub>烷基、N,N-二C<sub>1-4</sub>烷基氨基C<sub>2-5</sub>烷基、C<sub>1-3</sub>烷基羰基氨基C<sub>2-5</sub>烷基、或C<sub>1-4</sub>烷氧基羰基氨基C<sub>2-5</sub>烷基;或者

[0016] R<sup>8</sup>是C<sub>3-6</sub>环烷基、C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基、苯基、苯基C<sub>1-2</sub>烷基、杂芳基、杂芳基C<sub>1-2</sub>烷基(其中该杂芳基部分是包含1、2、3或4个单独地选自N、O和S的杂原子的5元或6元单环芳香族环)、杂环基、杂环基C<sub>1-2</sub>烷基(其中该杂环基部分是包含1或2个单独地选自N、O和S的杂原子的4元至6元非芳香族环);

[0017] 其中当R<sup>8</sup>是C<sub>3-6</sub>环烷基、C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基、苯基、苯基C<sub>1-2</sub>烷基、杂芳基、杂芳基C<sub>1-2</sub>烷基、杂环基、或杂环基C<sub>1-2</sub>烷基时,该C<sub>3-6</sub>环烷基、苯基、杂芳基、或杂环基基序任选地被1或2个取代基取代,所述取代基可以相同或不同,选自R<sup>9</sup>;

[0018] R<sup>9</sup>表示氰基、氟、氯、溴、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、或二氟甲氧基;并且其中当R<sup>8</sup>是被取代的C<sub>3-6</sub>环烷基或杂环基时,这些环可以含有羰基(C=O)或磺酰基(S(O)<sub>2</sub>)基团;或者

[0019] Z表示-N(R<sup>10</sup>)R<sup>11</sup>,其中

[0020] R<sup>10</sup>表示氢、C<sub>1-6</sub>烷基、C<sub>1-6</sub>卤代烷基、C<sub>1-4</sub>氰基烷基、羟基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>3-6</sub>烯基、C<sub>3-6</sub>炔基、氨基C<sub>2-4</sub>烷基、N-C<sub>1-4</sub>烷基氨基C<sub>2-4</sub>烷基、N,N-二C<sub>1-4</sub>烷基氨基C<sub>2-4</sub>烷基、甲酰基、C<sub>1-4</sub>烷基羰基、C<sub>1-4</sub>烷基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷基羰基氧基C<sub>1-4</sub>烷基、N-C<sub>1-4</sub>烷基氨基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、N,N-二C<sub>1-4</sub>烷基氨基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基羰基氨基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷基羰基氨基C<sub>2-4</sub>烷基、或C<sub>1-4</sub>卤代烷基羰基氨基C<sub>2-4</sub>烷基;或者

[0021] R<sup>10</sup>是C<sub>3-6</sub>环烷基、C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基、苯基、苯基C<sub>1-2</sub>烷基、杂芳基、杂芳基C<sub>1-2</sub>烷基(其中该杂芳基部分是包含1、2、3或4个单独地选自N、O和S的杂原子的5元或6元单环芳香族环)、杂环基、杂环基C<sub>1-2</sub>烷基(其中该杂环基部分是包含1或2个单独地选自N、O和S的杂原子的4元至6元非芳香族环);

[0022] 其中当R<sup>10</sup>是C<sub>3-6</sub>环烷基、C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基、苯基C<sub>1-2</sub>烷基、苯基、杂芳基、杂芳基C<sub>1-2</sub>烷基、杂环基、或杂环基C<sub>1-2</sub>烷基时,该C<sub>3-6</sub>环烷基、苯基、杂芳基、或杂环基基序任选地被1或2个取代基取代,所述取代基可以相同或不同,选自R<sup>12</sup>;

[0023] R<sup>12</sup>表示氰基、氟、氯、溴、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、或二氟甲氧基;并且其中当R<sup>10</sup>是被取代的C<sub>3-6</sub>环烷基或杂环基时,这些环可以含有羰基(C=O)或磺酰基(S(O)<sub>2</sub>)基团;

[0024] R<sup>11</sup>表示氢、羟基、C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>卤代烷基、C<sub>3-4</sub>烯基、C<sub>3-4</sub>炔基、C<sub>3-4</sub>环烷基、C<sub>3-4</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基、C<sub>3-4</sub>烯基氧基、或C<sub>3-4</sub>炔基氧基;或者

[0025] 其盐或N-氧化物。

[0026] 出人意料地,已经发现了,为实际目的,新颖的具有式(I)的化合物有着非常有利水平的用来保护植物免受由真菌引起的疾病的生物活性。

[0027] 根据本发明的第二方面,提供了一种包含杀真菌有效量的具有式(I)的化合物的农用化学组合物。此种农业组合物可以进一步包含至少一种另外的活性成分和/或农用化学上可接受的稀释剂或载体。

[0028] 根据本发明的第三方面,提供了一种控制或预防有用植物被植物病原性微生物感染的方法,其中将杀真菌有效量的具有式(I)的化合物、或包含该化合物作为活性成分的组合物施用于所述植物、其部分或其场所。

[0029] 根据本发明的第四方面,提供了具有式(I)的化合物作为杀真菌剂的用途。根据本发明的这个特定方面,所述用途可以不包括通过手术或疗法来治疗人体或动物体的方法。

[0030] 如本文使用的,术语“卤素(halogen或halo)”是指氟(fluorine, fluoro)、氯(chlorine, chloro)、溴(bromine, bromo)或碘(iodine, iodo),优选氟、氯或溴。

[0031] 如本文使用的,氰基意指-CN基团。

- [0032] 如本文使用的,术语“羟基(hydroxyl)”或“羟基(hydroxy)”意指-OH基团。
- [0033] 如本文使用的,氨基意指-NH<sub>2</sub>基团。
- [0034] 如本文使用的,酰基意指-C(O)CH<sub>3</sub>基团。
- [0035] 如本文使用的,甲酰基意指-C(O)H基团。
- [0036] 如本文使用的,术语“C<sub>1-6</sub>烷基”是指仅由碳原子和氢原子组成的直链的或支链的烃链基团,该烃链基团不含不饱和度,具有从一至六个碳原子,并且其通过单键附接至分子的其余部分。C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-3</sub>烷基和C<sub>1-2</sub>烷基应相应地解释。C<sub>1-6</sub>烷基的实例包括但不限于甲基、乙基、正丙基、1-甲基乙基(异丙基)、正丁基和1-二甲基乙基(叔丁基)。“C<sub>1-2</sub>亚烷基”基团是指C<sub>1-2</sub>烷基的相应定义,不同之处在于该基团是通过两个单键附接至分子的剩余部分。C<sub>1-2</sub>亚烷基的实例是-CH<sub>2</sub>-和-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-。
- [0037] 如本文使用的,术语“C<sub>2-6</sub>烯基”是指仅由碳原子和氢原子组成的直链的或支链的烃链基团,所述烃链基团含有至少一个可以是(E)-构型或(Z)-构型的双键,具有从两个至六个碳原子,其通过单键附接至分子的其余部分。C<sub>3-6</sub>烯基、C<sub>3-4</sub>烯基和C<sub>2-4</sub>烯基应相应地解释。C<sub>2-6</sub>烯基的实例包括但不限于乙烯基、丙-1-烯基和丁-1-烯基。
- [0038] 如本文使用的,术语“C<sub>2-6</sub>炔基”是指仅由碳原子和氢原子组成的直链的或支链的烃链基团,所述烃链基团含有至少一个三键,具有从两个至六个碳原子,并且其通过单键附接至分子的其余部分。C<sub>3-6</sub>炔基、C<sub>3-4</sub>炔基和C<sub>2-4</sub>炔基应相应地解释。C<sub>2-6</sub>炔基的实例包括但不限于乙炔基、丙-1-炔基和丁-1-炔基。
- [0039] 如本文使用的,氧代意指=O基团,例如酮基(-C(O)-)、亚磺酰基(-S(O)-)或磺酰基(-S(O)<sub>2</sub>-)氧中的。
- [0040] 如本文使用的,术语“C<sub>1-4</sub>烷氧基”是指具有式-OR<sub>x</sub>的基团,其中R<sub>x</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>烷基。术语C<sub>1-3</sub>烷氧基和C<sub>1-2</sub>烷氧基应相应地解释。C<sub>1-4</sub>烷氧基的实例包括但不限于甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基和叔丁氧基。
- [0041] 如本文使用的,术语“C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基”是指被一个或多个相同的或不同的卤素原子取代的如上定义的C<sub>1-2</sub>烷氧基。C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基的实例包括但不限于氟甲氧基、氟乙氧基、1,1,1-三氟甲氧基、和2,2,2-三氟乙氧基。
- [0042] 如本文使用的,术语“C<sub>1-6</sub>卤代烷基”是指被一个或多个相同的或不同的卤素原子取代的如上一般定义的C<sub>1-6</sub>烷基。因此,C<sub>1-4</sub>卤代烷基、C<sub>1-3</sub>卤代烷基和C<sub>1-2</sub>卤代烷基应相应地解释。C<sub>1-3</sub>卤代烷基的实例包括但不限于氟甲基、氟乙基、二氟甲基、三氟甲基、2,2,2-三氟乙基、以及3,3,3-三氟丙基。
- [0043] 如本文使用的,术语“C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基C<sub>1-4</sub>烷基”是指被如上定义的C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基取代的如上一般定义的C<sub>1-4</sub>烷基。因此,C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基C<sub>1-4</sub>烷基和C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基C<sub>1-2</sub>烷基应相应地解释。
- [0044] 如本文使用的,术语“羟基C<sub>2-4</sub>烷基”是指被一个或多个羟基取代的如上一般定义的C<sub>2-4</sub>烷基。术语“羟基C<sub>2-3</sub>烷基”应相应地解释。
- [0045] 如本文使用的,术语“氰基C<sub>1-4</sub>烷基”是指被一个或多个氰基取代的如上一般定义的C<sub>1-4</sub>烷基。氰基C<sub>1-2</sub>烷基应相应地解释。
- [0046] 如本文使用的,术语“C<sub>1-4</sub>烷基羰基”是指具有式-C(O)R<sub>x</sub>的基团,其中R<sub>x</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>烷基。C<sub>1-2</sub>烷基羰基应相应地解释。



[0047] 如本文使用的,术语“C<sub>3-4</sub>烯氧基”是指具有式-OR<sub>x</sub>的基团,其中R<sub>x</sub>是如上一般定义的C<sub>3-4</sub>烯基。

[0048] 如本文使用的,术语“C<sub>3-4</sub>炔氧基”是指具有式-OR<sub>x</sub>的基团,其中R<sub>x</sub>是如上一般定义的C<sub>3-4</sub>炔基。

[0049] 如本文使用的,术语“C<sub>1-4</sub>烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基”是指具有式R<sub>y</sub>-O-R<sub>x</sub>-的基团,其中R<sub>y</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>烷基,并且R<sub>x</sub>是如上一般定义的C<sub>2-4</sub>亚烷基。C<sub>1-2</sub>烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基和C<sub>1-2</sub>烷氧基C<sub>2-3</sub>烷基应相应地解释。

[0050] 如本文使用的,术语“C<sub>1-4</sub>烷基羰基氧基”是指具有式R<sub>x</sub>C(O)O-的基团,其中R<sub>x</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>烷基。

[0051] 如本文使用的,术语“C<sub>1-4</sub>烷基羰基氧基C<sub>1-4</sub>烷基”是指具有式R<sub>y</sub>C(O)OR<sub>x</sub>-的基团,其中R<sub>y</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>烷基,并且R<sub>x</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>亚烷基。C<sub>1-4</sub>烷基羰基氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-3</sub>烷基羰基氧基C<sub>2-4</sub>烷基和C<sub>1-2</sub>烷基羰基氧基C<sub>1-2</sub>烷基应相应地解释。

[0052] 如本文使用的,术语“C<sub>1-4</sub>烷氧基羰基C<sub>1-4</sub>烷基”是指具有式R<sub>y</sub>OC(O)R<sub>x</sub>-的基团,其中R<sub>y</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>烷基,并且R<sub>x</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>亚烷基。C<sub>1-3</sub>烷氧基羰基C<sub>1-3</sub>烷基和C<sub>1-2</sub>烷氧基羰基C<sub>1-2</sub>烷基应相应地解释。

[0053] 如本文使用的,术语“C<sub>1-4</sub>烷基羰基C<sub>1-4</sub>烷基”是指具有式R<sub>y</sub>(O)R<sub>x</sub>-的基团,其中R<sub>y</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>烷基,并且R<sub>x</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>亚烷基。因此,C<sub>1-3</sub>烷基羰基C<sub>1-3</sub>烷基和C<sub>1-2</sub>烷基羰基C<sub>1-2</sub>烷基应相应地解释。

[0054] 如本文使用的,术语“氨基C<sub>2-4</sub>烷基”是指具有式H<sub>2</sub>NR<sub>x</sub>-的基团,其中R<sub>x</sub>是如上定义的C<sub>2-4</sub>亚烷基。

[0055] 如本文使用的,术语“N-C<sub>1-4</sub>烷基氨基C<sub>2-5</sub>烷基”是指具有式R<sub>y</sub>NHR<sub>x</sub>-的基团,其中R<sub>y</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>烷基,并且R<sub>x</sub>是如上一般定义的C<sub>2-5</sub>亚烷基。

[0056] 如本文使用的,术语“N,N-二C<sub>1-4</sub>烷基氨基C<sub>2-5</sub>烷基”是指具有式(R<sub>y</sub>)<sub>2</sub>NHR<sub>x</sub>-的基团,其中每个R<sub>y</sub>独立地是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>烷基,并且R<sub>x</sub>是如上一般定义的C<sub>2-5</sub>亚烷基。

[0057] 如本文使用的,术语“N-C<sub>1-4</sub>烷基氨基羰基C<sub>1-4</sub>烷基”是指具有式R<sub>y</sub>NHC(O)R<sub>x</sub>-的基团,其中R<sub>y</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>烷基,并且R<sub>x</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>亚烷基。

[0058] 如本文使用的,术语“N,N-二C<sub>1-4</sub>烷基氨基羰基C<sub>1-4</sub>烷基”是指具有式(R<sub>y</sub>)<sub>2</sub>NHC(O)R<sub>x</sub>-的基团,其中每个R<sub>y</sub>独立地是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>烷基,并且R<sub>x</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>亚烷基。

[0059] 如本文使用的,术语“C<sub>1-4</sub>烷基羰基氨基C<sub>1-4</sub>烷基”是指具有式R<sub>y</sub>C(O)NHR<sub>x</sub>-的基团,其中R<sub>y</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>烷基,并且R<sub>x</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>亚烷基。

[0060] 如本文使用的,术语“C<sub>1-4</sub>卤代烷基羰基氨基C<sub>2-4</sub>烷基”是指具有式R<sub>y</sub>C(O)NHR<sub>x</sub>-的基团,其中R<sub>y</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>烷基(其被一个或多个相同或不同的卤素原子取代),并且R<sub>x</sub>是如上一般定义的C<sub>2-4</sub>亚烷基。

[0061] 如本文使用的,术语“C<sub>1-4</sub>烷氧基羰基氨基C<sub>1-4</sub>烷基”是指具有式R<sub>y</sub>OC(O)NHR<sub>x</sub>-的基团,其中R<sub>y</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>烷基,并且R<sub>x</sub>是如上一般定义的C<sub>1-4</sub>亚烷基。C<sub>1-4</sub>烷氧基羰基氨基C<sub>2-4</sub>烷基应相应地解释。

[0062] 如本文使用的,术语“C<sub>3-6</sub>环烷基”可以是单环的或二环的并且含有3至6个碳原子。C<sub>3-5</sub>环烷基和C<sub>3-4</sub>环烷基应相应地解释。C<sub>3-8</sub>环烷基的实例包括但不限于环丙基、1-甲基环丙

基、2-甲基环丙基、2,2-二氯环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环戊烯-1-基、环戊烯-3-基和环己烯-3-基。

[0063] 如本文使用的,术语“C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基”是指通过如上定义的C<sub>1-2</sub>亚烷基附接至分子的其余部分的如上定义的C<sub>3-6</sub>环烷基环。“C<sub>3-5</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基”和“C<sub>3-4</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基”应相应地解释。C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基的实例包括但不限于环丙基甲基、2,2-氯丙基甲基,环丁基乙基和环戊基甲基。

[0064] 如本文使用的,术语“苯基C<sub>1-2</sub>烷基”是指通过如上定义的C<sub>1-2</sub>亚烷基附接至分子的其余部分的苯环。苯基C<sub>1-2</sub>烷基的实例包括但不限于苄基。

[0065] 如本文使用的,术语“杂芳基”一般是指包含1、2、3或4个单独地选自N、O和S的杂原子的5元或6元单环芳香族环基团。该杂芳基经碳原子或杂原子键合至分子的其余部分。杂芳基的实例包括但不限于呋喃基、吡咯基、噁吩基、吡唑基、咪唑基、噻唑基、噁唑基、异噁唑基、三唑基、四唑基、吡嗪基、哒嗪基、嘧啶基、吡啶基、以及吲哚基。

[0066] 如本文使用的,术语“杂芳基C<sub>1-2</sub>烷基”通常是指包含1、2、3或4个单独地选自N、O和S的杂原子的5元或6元单环芳香族环基团,其通过如上定义的C<sub>1-2</sub>亚烷基附接至分子的其余部分。杂芳基C<sub>1-2</sub>烷基的实例包括但不限于噻吩基甲基、噻吩基乙基和吡啶基甲基。

[0067] 如本文使用的,术语“杂环基”或“杂环的”通常是指包含1或2个单独地选自N、O和S的杂原子的稳定的、饱和或部分饱和的4元至6元非芳香族单环。该杂环基可以经碳原子或杂原子键合至分子的剩余部分。杂环基的实例包括但不限于氮杂环丁烷基、氧杂环丁烷基、吡咯烷基、四氢呋喃基、四氢噻吩基、四氢硫代吡喃基、哌啶基、哌嗪基、四氢吡喃基、二氧戊环基和吗啉基。

[0068] 如本文使用的,术语“杂环基C<sub>1-2</sub>烷基”通常是指包含1或2个单独地选自N、O和S的杂原子的稳定的、饱和的或部分饱和的4元至6元非芳香族单环,其通过如上定义的C<sub>1-2</sub>亚烷基附接至分子的其余部分。

[0069] 在具有式(I)的化合物中一个或多个可能的不对称碳原子的存在意味着所述化合物能以手性异构体形式存在,即对映异构体或非对映异构体的形式。作为围绕单键的受限旋转的结果,还可能存在阻转异构体。式(I)旨在包括所有那些可能的异构体形式及其混合物。本发明包括具有式(I)的化合物的所有那些可能的异构体形式及其混合物。同样地,式(I)旨在包括所有可能的互变异构体(包括内酰胺-内酰亚胺互变异构和酮-烯醇互变异构)(当存在时)。本发明包括具有式(I)的化合物的所有可能的互变异构体形式。

[0070] 在每种情况下,根据本发明的具有式(I)的化合物是呈游离形式、氧化形式(作为N-氧化物)、共价水合形式、或盐形式(例如农艺学上可用的或农用化学上可接受的盐形式)。

[0071] N-氧化物是叔胺的氧化形式或含氮杂芳香族化合物的氧化形式。它们例如描述于CRC Press, Boca Raton [博卡拉顿CRC出版社] 1991年的A. Albini和S. Pietra的“Heterocyclic N-oxides [杂环N-氧化物]”一书中。

[0072] 以下清单提供了关于具有式(I)的化合物的取代基<sub>n</sub>、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、A<sup>4</sup>、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、Z、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、和R<sup>12</sup>的定义(包括优选的定义)。对于这些取代基中的任何一个,以下给出的任何定义都可以结合以下或在本文件中的其他地方给出的任何其他取代基的任何定义。

[0073]  $n$ 表示0、1或2。优选地, $n$ 是0或1。在本发明的一些实施例中, $n$ 是0。在本发明的其他实施例中, $n$ 是1。

[0074]  $A^1$ 表示N或 $CR^1$ ,其中 $R^1$ 表示氢、卤素或甲基。优选地, $A^1$ 表示N或 $CR^1$ ,其中 $R^1$ 表示氢、氟、氯或甲基。更优选地, $A^1$ 表示 $CR^1$ ,其中 $R^1$ 表示氢、氟、氯或甲基。更优选地, $A^1$ 表示 $CR^1$ ,其中 $R^1$ 表示氢或氟。

[0075]  $A^2$ 表示N或 $CR^2$ ,其中 $R^2$ 表示氢、卤素或甲基。优选地, $A^2$ 表示N或 $CR^2$ ,其中 $R^2$ 表示氢、氟、氯或甲基。更优选地, $A^2$ 表示N或 $CR^2$ ,其中 $R^2$ 表示氢或氟。

[0076]  $A^3$ 表示N或 $CR^3$ ,其中 $R^3$ 表示氢或氟。优选地, $A^3$ 表示 $CR^3$ ,其中 $R^3$ 表示氢或氟。

[0077]  $A^4$ 表示N或 $CR^4$ ,其中 $R^4$ 表示氢或氟。优选地, $A^4$ 表示 $CR^4$ ,其中 $R^4$ 表示氢或氟。

[0078]  $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $A^4$ 中的至少2个是C-H。

[0079] 优选地, $A^1$ 和 $A^2$ 各自独立地表示N、C-H或C-F, $A^3$ 和 $A^4$ 各自独立地表示C-H或C-F,其中 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $A^4$ 中的至少2个是C-H。

[0080] 在本发明的一个实施例中, $A^1$ 是C-F,并且 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $A^4$ 是C-H。在本发明的另一个实施例中, $A^2$ 是C-F,并且 $A^1$ 、 $A^3$ 和 $A^4$ 是C-H。在本发明的另一个实施例中, $A^3$ 是C-F,并且 $A^1$ 、 $A^2$ 和 $A^4$ 是C-H。在本发明的另一个实施例中, $A^4$ 是C-F,并且 $A^1$ 、 $A^2$ 和 $A^3$ 是C-H。在本发明的另一个实施例中, $A^2$ 和 $A^4$ 各自是C-F,并且 $A^1$ 和 $A^3$ 各自是C-H。

[0081] 在本发明的一个实施例中, $A^2$ 是N,并且 $A^1$ 、 $A^3$ 和 $A^4$ 是C-H。在本发明的另一个实施例中, $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $A^4$ 都是C-H。

[0082]  $R^5$ 和 $R^6$ 独立地表示氢、甲基、氰基、二氟甲基、或三氟甲基。优选地, $R^5$ 和 $R^6$ 都是氢或甲基,或 $R^5$ 是氢,并且 $R^6$ 是甲基。更优选地, $R^5$ 和 $R^6$ 都是氢。

[0083]  $R^7$ 表示氢、羟基、 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 卤代烷基、 $C_{1-4}$ 烷氧基、羟基 $C_{2-4}$ 烷基、 $C_{1-2}$ 烷氧基 $C_{2-4}$ 烷基、 $C_{1-2}$ 卤代烷氧基、 $C_{1-2}$ 卤代烷氧基 $C_{2-4}$ 烷基、 $C_{3-4}$ 烯基、 $C_{3-4}$ 炔基、 $C_{3-4}$ 烯基氧基、 $C_{3-4}$ 炔基氧基、 $C_{1-4}$ 烷基羰基氧基、 $C_{3-6}$ 环烷基或 $C_{3-6}$ 环烷基 $C_{1-2}$ 烷基。优选地, $R^7$ 表示氢、羟基、 $C_{1-4}$ 烷氧基、 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 卤代烷基、 $C_{1-2}$ 卤代烷氧基、 $C_{3-4}$ 烯基、 $C_{3-4}$ 炔基、 $C_{3-4}$ 烯基氧基、 $C_{3-4}$ 炔基氧基、 $C_{3-6}$ 环烷基、或 $C_{3-6}$ 环烷基 $C_{1-2}$ 烷基。更优选地, $R^7$ 表示氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基、环丙基或环丙基甲基。甚至更优选地, $R^7$ 表示氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基或环丙基。还更优选地, $R^7$ 表示氢、甲基、甲氧基或环丙基。最优选地, $R^7$ 表示氢、甲基或甲氧基。在一组实施例中, $R^7$ 表示甲氧基。

[0084]  $Z$ 表示 $R^8$ 或 $-N(R^{10})R^{11}$ 。

[0085] 当 $Z$ 表示 $R^8$ 时, $R^8$ 表示 $C_{1-6}$ 烷基、 $C_{2-6}$ 烯基、 $C_{2-6}$ 炔基、氰基 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 卤代烷基、 $C_{1-4}$ 烷氧基 $C_{2-4}$ 烷基、 $C_{1-2}$ 卤代烷氧基 $C_{2-4}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 烷基羰基 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 烷氧基羰基 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 烷基羰基氧基 $C_{2-4}$ 烷基、 $N-C_{1-4}$ 烷基氨基羰基 $C_{1-4}$ 烷基、 $N,N$ -二 $C_{1-4}$ 烷基氨基羰基 $C_{1-4}$ 烷基、 $N-C_{1-4}$ 烷基氨基 $C_{2-5}$ 烷基、 $N,N$ -二 $C_{1-4}$ 烷基氨基 $C_{2-5}$ 烷基、 $C_{1-3}$ 烷基羰基氨基 $C_{2-5}$ 烷基、或 $C_{1-4}$ 烷氧基羰基氨基 $C_{2-5}$ 烷基;或者

[0086]  $R^8$ 是 $C_{3-6}$ 环烷基、 $C_{3-6}$ 环烷基 $C_{1-2}$ 烷基、苯基、苯基 $C_{1-2}$ 烷基、杂芳基、杂芳基 $C_{1-2}$ 烷基(其中该杂芳基部分是包含1、2、3或4个单独地选自N、O和S的杂原子的5元或6元单环芳香族环)、杂环基、杂环基 $C_{1-2}$ 烷基(其中该杂环基部分是包含1或2个单独地选自N、O和S的杂原子的4元至6元非芳香族环);

[0087] 其中当 $R^8$ 是 $C_{3-6}$ 环烷基、 $C_{3-6}$ 环烷基 $C_{1-2}$ 烷基、苯基、苯基 $C_{1-2}$ 烷基、杂芳基、杂芳基

C<sub>1-2</sub>烷基、杂环基、或杂环基C<sub>1-2</sub>烷基时,该C<sub>3-6</sub>环烷基、苯基、杂芳基、或杂环基基序任选地被1或2个取代基取代,所述取代基可以相同或不同,选自R<sup>9</sup>;

[0088] R<sup>9</sup>表示氰基、氟、氯、溴、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、或二氟甲氧基;并且其中当R<sup>8</sup>是被取代的C<sub>3-6</sub>环烷基或杂环基时,这些环可以含有羰基(C=O)或磺酰基(S(O)<sub>2</sub>)基团;

[0089] 优选地,R<sup>8</sup>是C<sub>1-6</sub>烷基、C<sub>2-6</sub>烯基、C<sub>2-6</sub>炔基、氰基C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>卤代烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基羰基C<sub>1-4</sub>烷基、或C<sub>1-4</sub>烷基羰基氧基C<sub>2-4</sub>烷基;或者

[0090] R<sup>8</sup>是C<sub>3-6</sub>环烷基、C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基、苯基、苯基C<sub>1-2</sub>烷基、杂芳基、杂芳基C<sub>1-2</sub>烷基(其中该杂芳基部分是包含1、2或3个单独地选自N、O和S的杂原子的5元或6元单环芳香族环)、杂环基、或杂环基C<sub>1-2</sub>烷基(其中该杂环基部分是包含1或2个单独地选自N、O和S的杂原子的4元至6元非芳香族环);

[0091] 其中当R<sup>8</sup>是C<sub>3-6</sub>环烷基、C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基、苯基、苯基C<sub>1-2</sub>烷基、杂芳基、杂芳基C<sub>1-2</sub>烷基、杂环基、或杂环基C<sub>1-2</sub>烷基时,该C<sub>3-6</sub>环烷基、苯基、杂芳基、或杂环基基序任选地被1或2个取代基取代,所述取代基可以相同或不同,选自R<sup>9</sup>;

[0092] R<sup>9</sup>表示氰基、氟、氯、溴、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、或二氟甲氧基;并且其中当R<sup>8</sup>是被取代的C<sub>3-6</sub>环烷基或杂环基时,这些环可以含有羰基(C=O)或磺酰基(S(O)<sub>2</sub>)基团。

[0093] 更优选地,R<sup>8</sup>是C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>2-4</sub>烯基、C<sub>2-4</sub>炔基、氰基C<sub>1-2</sub>烷基、C<sub>1-3</sub>卤代烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-3</sub>烷基羰基C<sub>1-3</sub>烷基、C<sub>1-3</sub>烷氧基羰基C<sub>1-3</sub>烷基、或C<sub>1-3</sub>烷基羰基氧基C<sub>2-4</sub>烷基;或者

[0094] R<sup>8</sup>是C<sub>3-5</sub>环烷基、C<sub>3-5</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基、苯基、苯基C<sub>1-2</sub>烷基、杂芳基、杂芳基C<sub>1-2</sub>烷基(其中该杂芳基部分是包含1、2或3个单独地选自N、O和S的杂原子的5元或6元单环芳香族环)、杂环基、或杂环基C<sub>1-2</sub>烷基(其中该杂环基部分是包含1或2个单独地选自N、O和S的杂原子的4元至6元非芳香族环);

[0095] 其中当R<sup>8</sup>是C<sub>3-5</sub>环烷基、C<sub>3-5</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基、苯基、苯基C<sub>1-2</sub>烷基、杂芳基、杂芳基C<sub>1-2</sub>烷基、杂环基、或杂环基C<sub>1-2</sub>烷基时,该C<sub>3-5</sub>环烷基、苯基、杂芳基、或杂环基基序任选地被1或2个取代基取代,所述取代基可以相同或不同,选自R<sup>9</sup>;

[0096] R<sup>9</sup>表示氰基、氟、氯、溴、甲基、二氟甲基、三氟甲基或甲氧基;并且其中当R<sup>8</sup>是被取代的C<sub>3-5</sub>环烷基或杂环基时,R<sup>9</sup>还可以表示氧代基(C=O);

[0097] 更优选地,R<sup>8</sup>是C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>3-4</sub>烯基、C<sub>1-3</sub>卤代烷基、C<sub>1-2</sub>烷氧基C<sub>2-3</sub>烷基或C<sub>1-2</sub>烷氧基羰基C<sub>1-2</sub>烷基;或者

[0098] R<sup>8</sup>是C<sub>3-5</sub>环烷基、(C<sub>3-5</sub>环烷基)甲基、苯基、苄基、杂芳基、(杂芳基)甲基(其中该杂芳基部分是包含1或2个单独地选自N、O和S的杂原子的5元单环芳香族环)、杂环基或(杂环基)甲基(其中该杂环基部分是包含1或2个单独地选自N和O的杂原子的5元或6元非芳香族环);

[0099] 其中当R<sup>8</sup>是C<sub>3-5</sub>环烷基、(C<sub>3-5</sub>环烷基)甲基、苯基、苄基、杂芳基、(杂芳基)甲基、杂环基、或(杂环基)甲基时,该C<sub>3-5</sub>环烷基、苯基、杂芳基、或杂环基基序任选地被1或2个取代基取代,所述取代基可以相同或不同,选自R<sup>9</sup>;

[0100]  $R^9$ 表示氰基、氟、氯、溴、甲基或甲氧基。

[0101] 甚至更优选地,  $R^8$ 是甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、叔丁基、烯丙基、丙-1-烯基、异丙烯基、1,1-二氟甲基、1,1,1-三氟甲基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、3,3,3-三氟丙基、甲氧基甲基、甲氧基乙基、甲氧基羰基甲基、甲氧基羰基乙基、乙氧基羰基甲基、乙氧基羰基乙基、环丙基、环丁基、环戊基、环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基、2,2-二氟环丙基甲基、2,2-二氯环丙基甲基、苯基、苄基、2-氟苯基、2,4-二氟苯基、2,4-二氯苯基、4-氯-2-氟苯基、4-氟-2-氯苯基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、1-甲基吡啶-3-基、1-甲基吡啶-4-基、噻吩-2-基、噻吩-3-基、2-甲基噻吩-5-基、2-甲基噻吩-4-基、四氢呋喃-2-基、四氢呋喃-3-基、四氢呋喃-2-基甲基、四氢呋喃-3-基甲基、吗啉基、吡咯烷-1-基、吡咯烷-2-基、吡咯烷-3-基、哌啶-1-基、哌啶-2-基、哌啶-3-基、或哌啶-4-基。

[0102] 还更优选地,  $R^8$ 是甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、烯丙基、丙-1-烯基、3,3,3-三氟丙基、甲氧基乙基、甲氧基羰基甲基、甲氧基羰基乙基、环丙基、环丙基甲基、2,2-二氟环丙基甲基、苯基、苄基、2-氟苯基、2,4-二氟苯基、4-氯-2-氟苯基、1-甲基吡啶-3-基、2-甲基噻吩-5-基、或四氢呋喃-3-基甲基。

[0103] 在另一组优选的实施例中,  $R^8$ 是甲基、乙基、甲氧基乙基、环丙基或环丙基甲基。

[0104] 当Z表示 $-N(R^{10})R^{11}$ 时,  $R^{10}$ 表示氢、 $C_{1-6}$ 烷基、 $C_{1-6}$ 卤代烷基、氰基 $C_{1-4}$ 烷基、羟基 $C_{2-4}$ 烷基、 $C_{1-2}$ 烷氧基 $C_{2-4}$ 烷基、 $C_{1-2}$ 卤代烷氧基 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{3-6}$ 烯基、 $C_{3-6}$ 炔基、氨基 $C_{2-4}$ 烷基、 $N-C_{1-4}$ 烷基氨基 $C_{2-4}$ 烷基、 $N,N$ -二 $C_{1-4}$ 烷基氨基 $C_{2-4}$ 烷基、甲酰基、 $C_{1-4}$ 烷基羰基、 $C_{1-4}$ 烷基羰基 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 烷氧基羰基 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 烷基羰基氧基 $C_{1-4}$ 烷基、 $N-C_{1-4}$ 烷基氨基羰基 $C_{1-4}$ 烷基、 $N,N$ -二 $C_{1-4}$ 烷基氨基羰基 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 烷氧基羰基氨基 $C_{2-4}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 烷基羰基氨基 $C_{2-4}$ 烷基、或 $C_{1-4}$ 卤代烷基羰基氨基 $C_{2-4}$ 烷基;或者

[0105]  $R^{10}$ 是 $C_{3-6}$ 环烷基、 $C_{3-6}$ 环烷基 $C_{1-2}$ 烷基、苯基、苯基 $C_{1-2}$ 烷基、杂芳基、杂芳基 $C_{1-2}$ 烷基(其中该杂芳基部分是包含1、2、3或4个单独地选自N、O和S的杂原子的5元或6元单环芳香族环)、杂环基、或杂环基 $C_{1-2}$ 烷基(其中该杂环基部分是包含1或2个单独地选自N、O和S的杂原子的4元至6元非芳香族环);

[0106] 其中当 $R^{10}$ 是 $C_{3-6}$ 环烷基、 $C_{3-6}$ 环烷基 $C_{1-2}$ 烷基、苯基 $C_{1-2}$ 烷基、苯基、杂芳基、杂芳基 $C_{1-2}$ 烷基、杂环基、或杂环基 $C_{1-2}$ 烷基时,该 $C_{3-6}$ 环烷基、苯基、杂芳基、或杂环基基序任选地被1或2个取代基取代,所述取代基可以相同或不同,选自 $R^{12}$ ;

[0107]  $R^{12}$ 表示氰基、氟、氯、溴、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、或二氟甲氧基;并且其中当 $R^{10}$ 是被取代的 $C_{3-6}$ 环烷基或杂环基时,这些环可以含有羰基( $C=O$ )或磺酰基( $S(O)_2$ )基团。

[0108] 优选地,  $R^{10}$ 表示氢、 $C_{1-6}$ 烷基、 $C_{1-6}$ 卤代烷基、氰基 $C_{1-4}$ 烷基、羟基 $C_{2-4}$ 烷基、 $C_{1-2}$ 烷氧基 $C_{2-4}$ 烷基、 $C_{1-2}$ 卤代烷氧基 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{3-6}$ 烯基、 $C_{3-6}$ 炔基、甲酰基、 $C_{1-4}$ 烷基羰基、 $C_{1-4}$ 烷基羰基 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 烷氧基羰基 $C_{1-4}$ 烷基、或 $C_{1-4}$ 烷基羰基氧基 $C_{1-4}$ 烷基;或者

[0109]  $R^{10}$ 是 $C_{3-6}$ 环烷基、 $C_{3-6}$ 环烷基 $C_{1-2}$ 烷基、苯基、或苯基 $C_{1-2}$ 烷基;

[0110] 其中当 $R^{10}$ 是 $C_{3-6}$ 环烷基、 $C_{3-6}$ 环烷基 $C_{1-2}$ 烷基、苯基、或苯基 $C_{1-2}$ 烷基时,该 $C_{3-6}$ 环烷基或苯基基序任选地被1或2个取代基取代,所述取代基可以相同或不同,选自 $R^{12}$ ;

[0111]  $R^{12}$ 表示氰基、氟、氯、溴、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、或二氟甲氧基;并且其中当 $R^{10}$ 是被取代的 $C_{3-6}$ 环烷基或杂环基时,这些环可以含有羰基( $C=O$ )或磺酰基

(S(O)<sub>2</sub>)基团。

[0112] 更优选地, R<sup>10</sup>表示氢、C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>卤代烷基、氰基C<sub>1-2</sub>烷基、羟基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>烷氧基C<sub>2-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基C<sub>1-2</sub>烷基、C<sub>3-4</sub>烯基、C<sub>3-4</sub>炔基、甲酰基、C<sub>1-2</sub>烷基羰基、C<sub>1-2</sub>烷基羰基C<sub>1-2</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>烷氧基羰基C<sub>1-2</sub>烷基、或C<sub>1-2</sub>烷基羰基氧基C<sub>1-2</sub>烷基;或者

[0113] R<sup>10</sup>是C<sub>3-6</sub>环烷基或C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基;

[0114] 其中当R<sup>10</sup>是C<sub>3-6</sub>环烷基或C<sub>3-6</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基时, C<sub>3-6</sub>环烷基基序任选地被1或2个取代基取代, 所述取代基可以相同或不同, 选自R<sup>12</sup>;

[0115] R<sup>12</sup>表示氰基、氟、氯、溴、甲基或甲氧基; 并且其中当R<sup>10</sup>是被取代的C<sub>3-6</sub>环烷基或杂环基时, 这些环可以含有羰基(C=O)基团。

[0116] 还更优选地, R<sup>10</sup>表示氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、叔丁基、1,1-二氟甲基、氰基甲基、羟基甲基、甲氧基甲基、烯丙基、炔丙基、甲酰基、甲基羰基、甲氧基羰基甲基、环丙基或环丙基甲基。

[0117] 最优选地, R<sup>10</sup>表示氢或甲基。

[0118] R<sup>11</sup>表示氢、羟基、C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>卤代烷基、C<sub>3-4</sub>烯基、C<sub>3-4</sub>炔基、C<sub>3-4</sub>环烷基、C<sub>3-4</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基、C<sub>3-4</sub>烯基氧基、或C<sub>3-4</sub>炔基氧基。优选地, R<sup>11</sup>表示氢、羟基、C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>卤代烷基、C<sub>3-4</sub>烯基、C<sub>3-4</sub>炔基、C<sub>3-4</sub>环烷基、C<sub>3-4</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基、C<sub>3-4</sub>烯基氧基、或C<sub>3-4</sub>炔基氧基。更优选地, R<sup>11</sup>表示氢、羟基、C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-2</sub>卤代烷基、C<sub>3-4</sub>烯基、C<sub>3-4</sub>炔基、C<sub>3-4</sub>环烷基、C<sub>3-4</sub>环烷基C<sub>1-2</sub>烷基或C<sub>1-4</sub>烷氧基。还更优选地, R<sup>11</sup>表示甲基、乙基、正丙基或炔丙基。最优选地, R<sup>11</sup>表示甲基、乙基或正丙基。

[0119] 优选地, 根据式(I)的化合物选自表T1(下文)中列出的化合物1.1至1.112、表T2(下文)中列出的化合物2.1至2.39、表T3(下文)中列出的化合物3.1至3.36、或表T4(下文)中列出的化合物4.1至4.2。

[0120] 优选地, 在本发明的根据式(I)的化合物中, n是0或1;

[0121] A<sup>1</sup>表示C-H;

[0122] A<sup>2</sup>表示N或CR<sup>2</sup>, 其中R<sup>2</sup>是氢或氟;

[0123] A<sup>3</sup>表示C-H;

[0124] A<sup>4</sup>表示CR<sup>4</sup>, 其中R<sup>4</sup>是氢或氟;

[0125] R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>独立地表示氢或甲基;

[0126] R<sup>7</sup>选自甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基和环丙基;

[0127] Z表示R<sup>8</sup>;

[0128] R<sup>8</sup>表示甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、烯丙基、丙-1-烯基、3,3,3-三氟丙基、甲氧基乙基、甲氧基羰基甲基、甲氧基羰基乙基、环丙基、环丙基甲基、环戊基甲基、2,2-二氟环丙基甲基、苯基、苄基、2,4-二氟苯基、4-氯-2-氟苯基、1-甲基吡啶-3-基、2-甲基噻吩-5-基、四氢呋喃-3-基甲基、吡咯烷基或吗啉基。

[0129] 优选地, 在本发明的根据式(I)的化合物中, n是1;

[0130] A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>和A<sup>4</sup>各自独立地表示C-H;

[0131] R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>独立地表示氢或甲基;

[0132] R<sup>7</sup>选自氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基和环丙基;

[0133] Z表示R<sup>8</sup>;

[0134]  $R^8$ 表示甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、烯丙基、丙-1-烯基、3,3,3-三氟丙基、甲氧基乙基、甲氧基羰基甲基、甲氧基羰基乙基、环丙基、环戊基甲基、2,2-二氟环丙基甲基、苯基、苄基、1-甲基吡啶-3-基、2-甲基噻吩-5-基、四氢呋喃-3-基甲基、吡咯烷基或吗啉基。

[0135] 更优选地,在本发明的根据式(I)的化合物中, $n$ 是1;

[0136]  $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $A^4$ 各自独立地表示C-H;

[0137]  $R^5$ 和 $R^6$ 均表示氢;

[0138]  $R^7$ 选自氢、甲基、甲氧基和环丙基;

[0139]  $Z$ 表示 $R^8$ ;

[0140]  $R^8$ 表示甲基、乙基、甲氧基乙基、环丙基、环丙基甲基、环戊基甲基或吗啉基。

[0141] 优选地,在本发明的根据式(I)的化合物中, $n$ 是1;

[0142]  $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $A^4$ 各自独立地表示C-H;

[0143]  $R^5$ 和 $R^6$ 独立地表示氢或甲基;

[0144]  $R^7$ 选自氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基和环丙基;

[0145]  $Z$ 表示 $-N(R^{10})R^{11}$ ;

[0146]  $R^{10}$ 表示氢或甲基;

[0147]  $R^{11}$ 表示甲基、乙基、正丙基或烯丙基。

[0148] 更优选地,在本发明的根据式(I)的化合物中, $n$ 是1;

[0149]  $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $A^4$ 各自独立地表示C-H;

[0150]  $R^5$ 和 $R^6$ 均表示氢;

[0151]  $R^7$ 选自氢、甲基和环丙基;

[0152]  $Z$ 表示 $-N(R^{10})R^{11}$ ;

[0153]  $R^{10}$ 表示氢或甲基;

[0154]  $R^{11}$ 表示甲基、乙基或正丙基。

[0155] 优选地,在本发明的根据式(I)的化合物中, $n$ 是0或1;

[0156]  $A^1$ 表示 $CR^1$ ,其中 $R^1$ 是氢或氟;

[0157]  $A^2$ 表示N或C-H;

[0158]  $A^3$ 表示 $CR^3$ ,其中 $R^3$ 是氢或氟;

[0159]  $A^4$ 表示C-H;

[0160]  $R^5$ 和 $R^6$ 均表示氢;

[0161]  $R^7$ 表示氢;

[0162]  $Z$ 表示 $R^8$ ;

[0163]  $R^8$ 表示甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、烯丙基、丙-1-烯基、3,3,3-三氟丙基、甲氧基乙基、甲氧基羰基甲基或甲氧基羰基乙基。

[0164] 优选地,在本发明的根据式(I)的化合物中, $n$ 是0或1;

[0165]  $A^1$ 表示 $CR^1$ ,其中 $R^1$ 是氢或氟;

[0166]  $A^2$ 表示C-H;

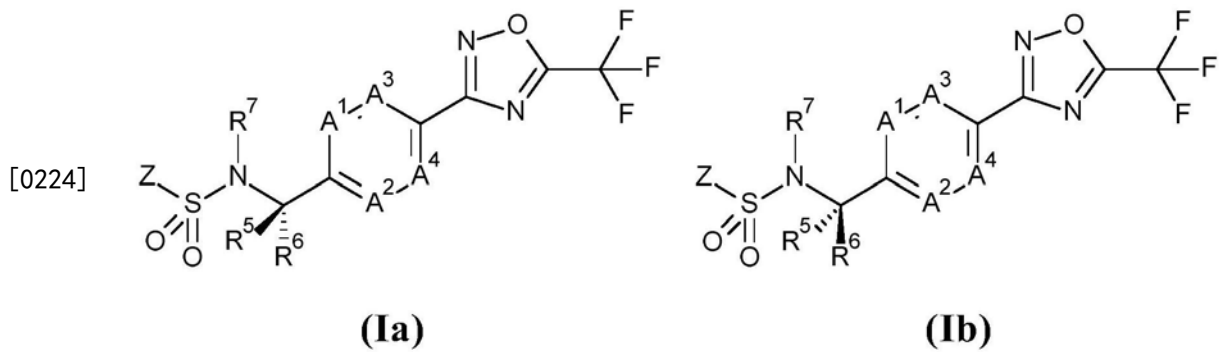
[0167]  $A^3$ 表示 $CR^3$ ,其中 $R^3$ 是氢或氟;

[0168]  $A^4$ 表示C-H;

- [0169]  $R^5$ 和 $R^6$ 均表示氢；
- [0170]  $R^7$ 表示氢；
- [0171] Z表示 $N(R^{10})R^{11}$ ；
- [0172]  $R^{10}$ 表示氢或甲基；
- [0173]  $R^{11}$ 表示甲基。
- [0174] 优选地,在本发明的根据式(I)的化合物中,n是0或1；
- [0175]  $A^1$ 表示 $CR^1$ ,其中 $R^1$ 是氢或氟；
- [0176]  $A^2$ 表示N或C-H；
- [0177]  $A^3$ 表示 $CR^3$ ,其中 $R^3$ 是氢或氟；
- [0178]  $A^4$ 表示C-H；
- [0179]  $R^5$ 和 $R^6$ 均表示氢；
- [0180]  $R^7$ 表示氢；
- [0181] Z表示 $R^8$ ；
- [0182]  $R^8$ 表示环丙基、环丙基甲基、环戊基甲基、2,2-二氟环丙基甲基、苯基、苄基、2-氟苯基、2,4-二氟苯基、4-氯-2-氟苯基、1-甲基吡啶-3-基、2-甲基噻吩-5-基、四氢呋喃-3-基甲基、吡咯烷基或吗啉基。
- [0183] 以下组合表示特别优选的实施例：
- [0184] 根据本发明的具有式(I)的化合物,其中n是1；
- [0185]  $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $A^4$ 是C-H；
- [0186]  $R^5$ 和 $R^6$ 是氢；其中：
- [0187]  $R^7$ 表示甲氧基；
- [0188] Z表示 $R^8$ ,其中 $R^8$ 是甲基、乙基、环丙基、甲氧基乙基、甲氧基羰基甲基、甲氧基羰基乙基、3,3,3-三氟丙基、2,2-二氯环丙基甲基、丙-1-烯基、烯丙基、吡咯烷-1-基、1-甲基吡啶-3-基或2-甲基噻吩-5-基；或者
- [0189] Z表示 $N(R^{10})R^{11}$ ,其中 $R^{10}$ 表示氢或甲基,并且 $R^{11}$ 表示甲基、乙基或正丙基；或者
- [0190]  $R^7$ 表示氢；
- [0191] Z表示 $R^8$ ,其中 $R^8$ 是甲氧基乙基、甲氧基羰基甲基、甲氧基羰基乙基、3,3,3-三氟丙基、2,2-二氯环丙基甲基、丙-1-烯基、烯丙基、吡咯烷-1-基、吗啉基、2-氟苯基、2,4-二氟苯基、4-氯-2-氟苯基、四氢呋喃-3-基甲基、1-甲基吡啶-3-基、或2-甲基噻吩-5-基；或者
- [0192]  $R^7$ 表示乙基或正丙基；
- [0193] Z表示 $R^8$ ,其中 $R^8$ 是甲氧基乙基、甲氧基羰基甲基、甲氧基羰基乙基、3,3,3-三氟丙基、2,2-二氯环丙基甲基、丙-1-烯基、烯丙基、吡咯烷-1-基、四氢呋喃-3-基甲基、1-甲基吡啶-3-基、或2-甲基噻吩-5-基；或者
- [0194] Z表示 $N(R^{10})R^{11}$ ,其中 $R^{10}$ 表示氢,并且 $R^{11}$ 表示炔丙基；或者
- [0195]  $R^7$ 表示异丙基；
- [0196] Z表示 $R^8$ ,其中 $R^8$ 是甲氧基乙基、甲氧基羰基甲基、丙-1-烯基、吡咯烷-1-基、1-甲基吡啶-3-基或2-甲基噻吩-5-基；或者
- [0197] 根据本发明的具有式(I)的化合物,其中n是1；
- [0198]  $A^1$ 、 $A^2$ 和 $A^4$ 是C-H；

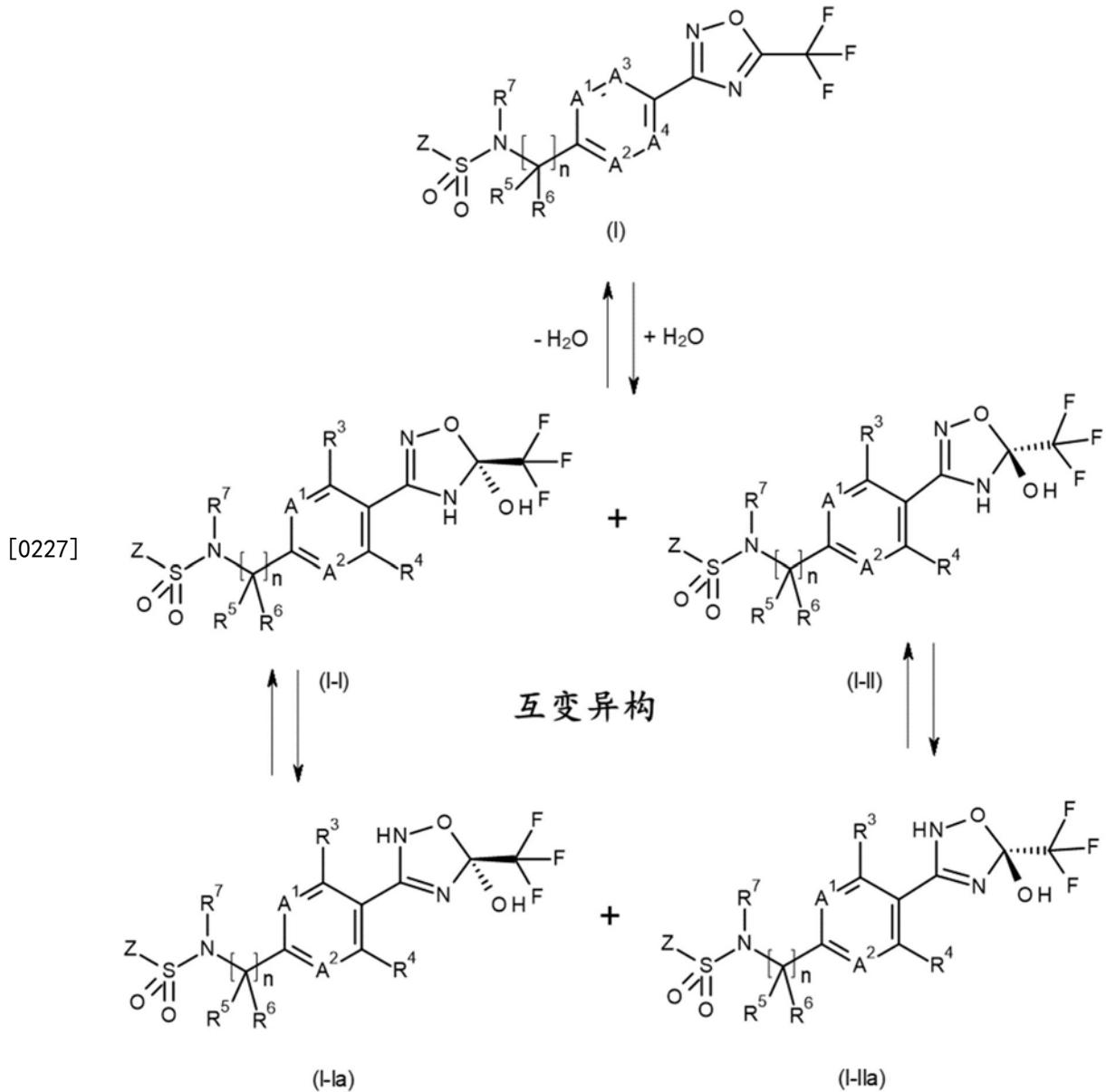


- [0199]  $A^3$ 是C-F;
- [0200]  $R^5$ 和 $R^6$ 是氢;
- [0201]  $R^7$ 是氢;
- [0202] Z表示 $R^8$ ,其中 $R^8$ 是甲基、乙基、正丙基、正丁基、环丙基、环丙基甲基、环戊基甲基、甲氧基乙基、甲氧基羰基甲基、甲氧基羰基乙基、3,3,3-三氟丙基、2,2-二氯环丙基甲基、丙-1-烯基、烯丙基、吡咯烷-1-基、苯基、苄基、四氢呋喃-3-基甲基、1-甲基吡啶-3-基、或2-甲基噻吩-5-基;或者
- [0203] Z表示 $N(R^{10})R^{11}$ ,其中 $R^{10}$ 表示氢或甲基,并且 $R^{11}$ 表示甲基;
- [0204] 根据本发明的具有式(I)的化合物,其中n是1;
- [0205]  $A^2$ 、 $A^3$ 以及 $A^4$ 是C-H;
- [0206]  $A^1$ 是C-F;
- [0207]  $R^5$ 和 $R^6$ 是氢;
- [0208]  $R^7$ 是氢;
- [0209] Z表示 $R^8$ ,其中 $R^8$ 是甲基、乙基、异丙基、正丁基、环丙基、环丙基甲基、环戊基甲基、甲氧基乙基、甲氧基羰基甲基、甲氧基羰基乙基、3,3,3-三氟丙基、2,2-二氯环丙基甲基、丙-1-烯基、烯丙基、吡咯烷-1-基、苯基、苄基、四氢呋喃-3-基甲基、1-甲基吡啶-3-基、或2-甲基噻吩-5-基;或者
- [0210] Z表示 $N(R^{10})R^{11}$ ,其中 $R^{10}$ 表示氢或甲基,并且 $R^{11}$ 表示甲基;
- [0211] 根据本发明的具有式(I)的化合物,其中n是1;
- [0212]  $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $A^4$ 是C-H;
- [0213]  $R^5$ 和 $R^6$ 各自独立地表示氢或甲基;
- [0214]  $R^7$ 表示甲基、乙基或环丙基;并且
- [0215] Z表示 $R^8$ ,其中 $R^8$ 是甲基;或者
- [0216]  $R^7$ 表示甲基;并且
- [0217] Z表示 $N(R^{10})R^{11}$ ,其中 $R^{10}$ 和 $R^{11}$ 各自独立地表示甲基。
- [0218] 根据本发明的具有式(I)的化合物,其中n是2;
- [0219]  $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $A^4$ 是C-H;
- [0220]  $R^5$ 和 $R^6$ 各自独立地表示氢或甲基;
- [0221]  $R^7$ 表示甲氧基;
- [0222] Z表示 $R^8$ ,其中 $R^8$ 是甲基。
- [0223] 本发明的化合物可以是如由式(Ia)或式(Ib)表示的具有式(I)的化合物的对映异构体,当n是1时,其中 $R^5$ 和 $R^6$ 不同(见下文),或者实际上当n是2时并且仅在与 $R^5$ 和 $R^6$ 结合的两个碳位置之一处, $R^5$ 和 $R^6$ 不同。



[0225] 同样地,本发明的化合物可以是具有式(I)的化合物的非对映异构体,当n是2时,并且其中在与R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>结合的两个碳位置中的每一个处,R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>不同。

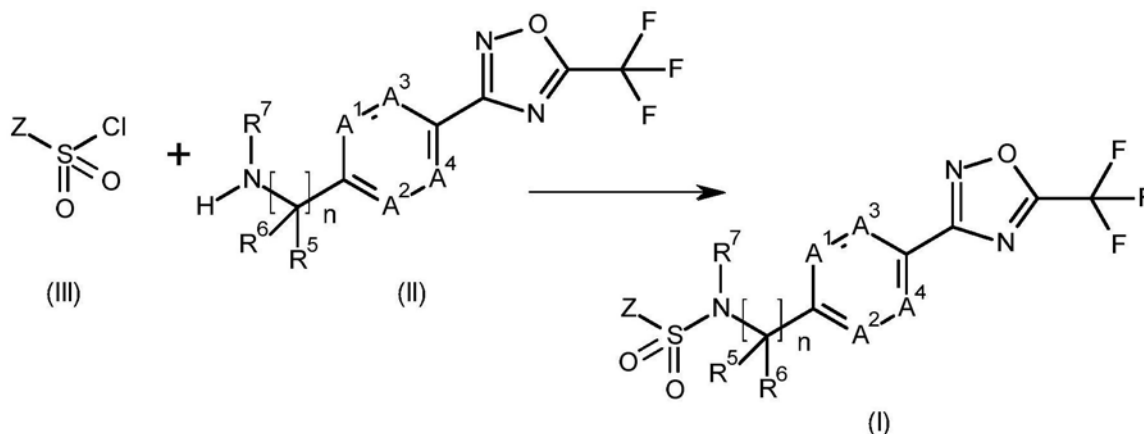
[0226] 应理解,当在水性介质中时,根据本发明的具有式(I)的化合物可以与相应的共价水合的形式(即,如下文所示的具有式(I-I)和式(I-II)的化合物,其可以作为具有式(I-Ia)和式(I-IIa)的化合物的互变异构形式存在)在CF<sub>3</sub>-噁二唑基序处可逆平衡地存在。该动态平衡对于具有式(I)的化合物的生物活性可能是重要的。关于本发明的具有式(I)的化合物的n、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、A<sup>4</sup>、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、Z、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、和R<sup>12</sup>的指定一般适用于具有式(I-I)、(I-II)、(I-Ia)和(I-IIa)的化合物,并且适用于如在以下表1.1至1.7和2.1至2.7中的化合物、或表T1(下文)中描述的化合物1.1至1.112、表T2(下文)中描述的化合物2.1至2.39、表T3(下文)中描述的化合物3.1至3.36、以及表T4(下文)中描述的化合物4.1至4.2中表示的n、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、A<sup>4</sup>、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、Z、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、和R<sup>12</sup>的组合的具体披露内容。



[0228] 本发明的化合物可以如在以下方案1至12中所示来制备,其中(除非另外说明)每一变量的定义是如上针对具有式(I)的化合物所定义的。

[0229] 具有式(I)的化合物可以在合适的溶剂(例如二氯甲烷)中,优选在0°C与25°C之间的温度下,并且任选地在碱(例如三乙胺或吡啶)的存在下,或在文献中描述的酰胺偶联条件下,通过具有式(II)的化合物和具有式(III)的化合物的偶联转化获得。例如,参见WO2012/068251或Oshima, T.等人. *Angew. Chem., Int. Ed*[应用化学国际版](2015), 54, 7193。此外,具有式(III)的化合物是可商购的或可使用已知方法制备。例如,参见Lin, Wenwei等人. *Eur. J. Med. Chem*[欧洲药物化学杂志]. (2016), 108, 505; WO 2002/053557; 或 WO 2008/115381。该反应示于方案1中。

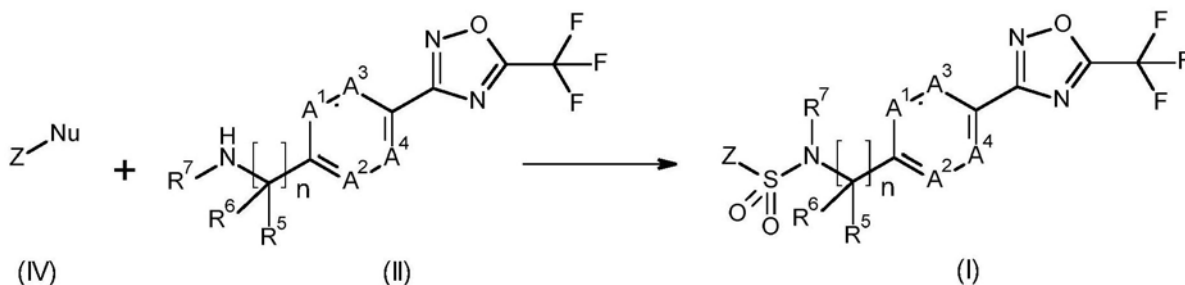
[0230]



[0231] 方案1

[0232] 或者,具有式 (I) 的化合物可以经由以下从具有式 (II) 的化合物制备:在合适的溶剂(例如乙腈或氯仿)中在 $0^{\circ}C$ 与 $40^{\circ}C$ 之间的温度下用 $SO_2Cl_2$ 处理,随后在碱(例如三乙胺或 $Et_3N$ )的存在下添加合适的具有式 (IV) 的亲核试剂,任选地随后在 $25^{\circ}C$ 和 $75^{\circ}C$ 的温度下加热。例如,参见Lin, Wenwei等人. *Eur. J. Med. Chem.* [欧洲药物化学杂志] (2016), 108, 505; WO 2002/053557; WO 2008/115381, 或2009002495。该反应示于方案2中。

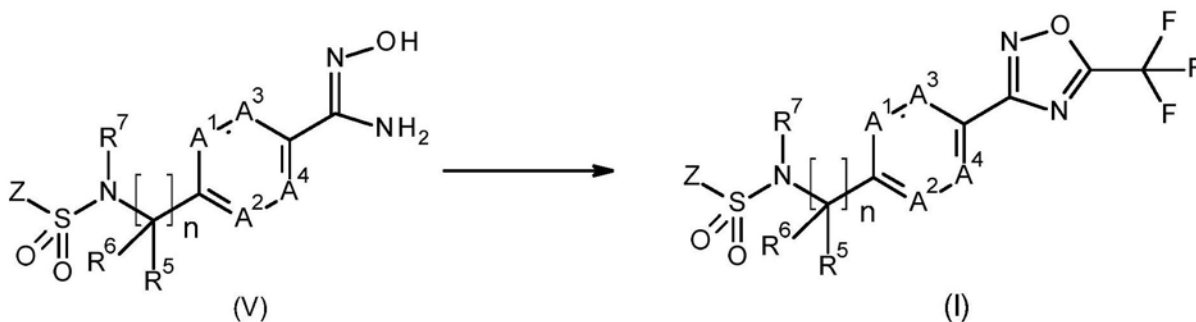
[0233]



[0234] 方案2

[0235] 另外,具有式 (I) 的化合物可以通过在 $25^{\circ}C$ 与 $75^{\circ}C$ 之间的温度下在合适的溶剂(如四氢呋喃或乙醇)中在碱(例如,吡啶或4-二甲基氨基吡啶)的存在下用三氟乙酸酐处理从具有式 (V) 的化合物制备。对于相关实例,参见WO 2003/028729和WO 2010/045251。该反应示于方案3中。

[0236]

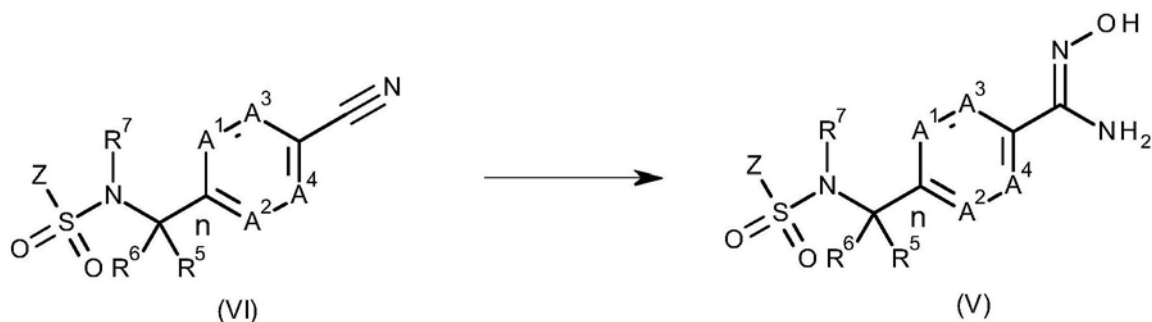


[0237] 方案3

[0238] 具有式 (V) 的化合物可以通过在 $0^{\circ}C$ 与 $100^{\circ}C$ 之间的温度下在合适的溶剂(如甲醇)

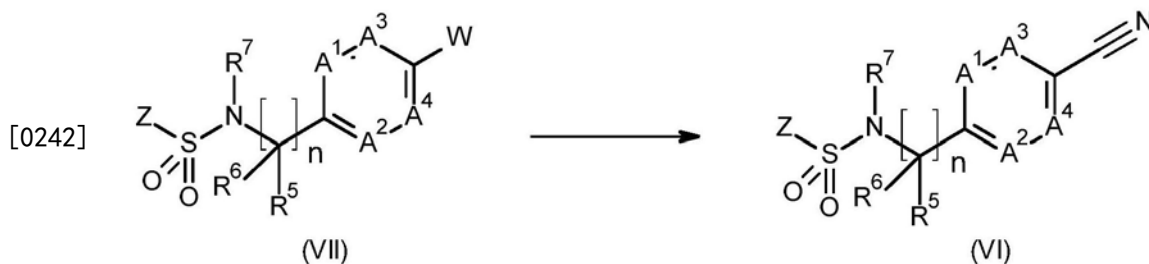
中在碱(如三乙胺)的存在下用羟胺盐酸盐处理从具有式(VI)的化合物制备。对于相关实例,参见Kitamura, S.等人Chem. Pharm. Bull. [化学与药学通报] (2001), 49, 268和WO 2013/066838。该反应示于方案4中。

[0239]



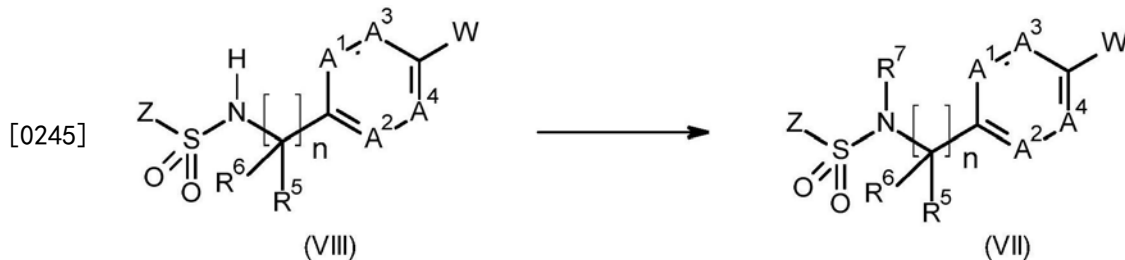
[0240] 方案4

[0241] 具有式(VI)的化合物可以经由在合适的溶剂(例如,二甲基甲酰胺或N-甲基吡咯烷酮)中在100°C与120°C之间的升高的温度下用合适的氰化物试剂(如Pd(0)/Zn(CN)<sub>2</sub>或CuCN)进行金属促进反应由具有式(VII)的化合物(其中W是Br或I)制备。对于相关实例,参见US 2007/0155739和WO 2009/022746。该反应示于方案5中。



[0243] 方案5

[0244] 具有式(VII)的化合物(其中N-R<sup>7</sup>键含有直接连接的-CH<sub>2</sub>段)可以通过在100°C与120°C之间的升高的温度下在合适的溶剂(例如,二甲基甲酰胺或N-甲基吡咯烷酮)中与合适的烷基化试剂(例如,甲基碘或丙基碘)进行碱促进的反应(例如,氢化钠)从具有式(VIII)的化合物(其中W是Br、I或CN)制备。该反应示于方案6中。

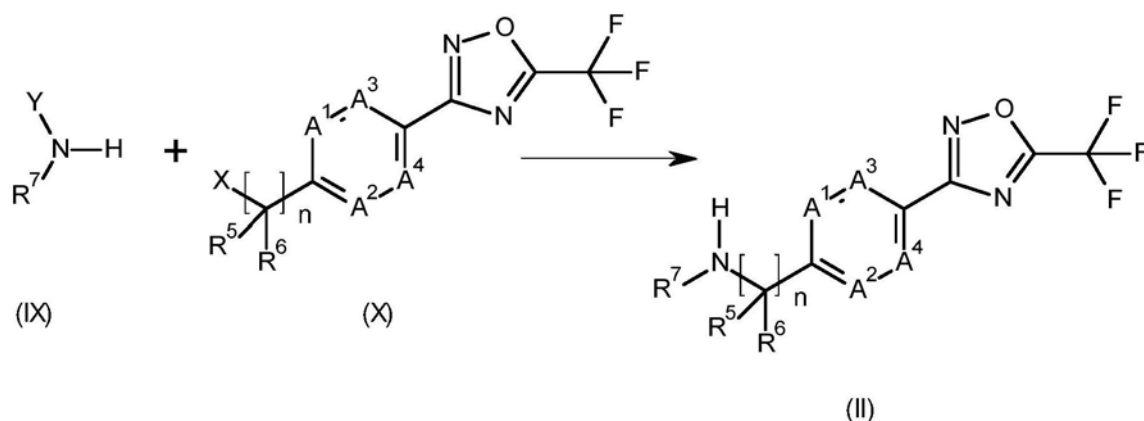


[0246] 方案6

[0247] 可替代地,具有式(II)的化合物(其中n优选是1)可以通过在25°C与60°C之间的温度下在合适的溶剂(例如,四氢呋喃)中用具有式(IX)的胺(其中Y是氢或叔丁基甲酸酯)进行处理从具有式(X)的化合物(其中X是Cl或Br)制备。在合适的溶剂(例如,二噁烷或MeOH)中用HCl或三氟乙酸处理后,除去叔丁基甲酸酯基团并伴随释放具有式(II)的苄胺。对于相关实例,参见Miyawaki, K.等人, Heterocycles [杂环] (2001), 54, 887、WO 2003/028729和WO

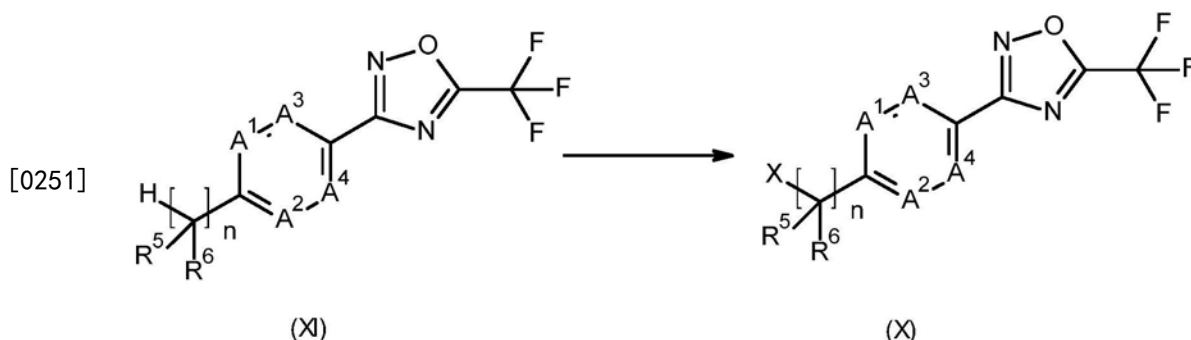
2013/066839。该反应示于方案7中。

[0248]



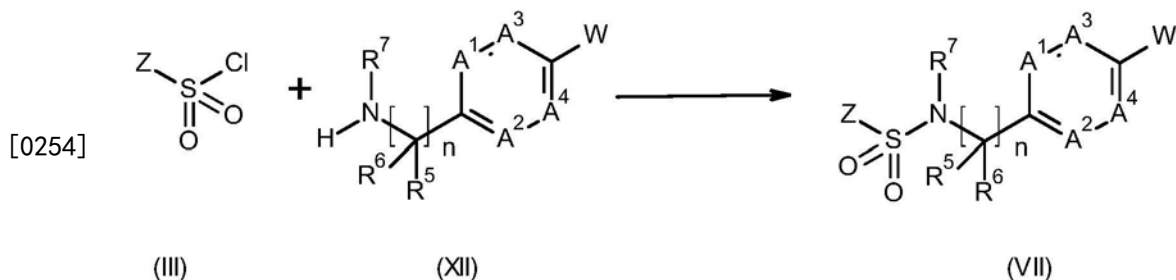
[0249] 方案7

[0250] 具有式 (X) 的化合物 (其中n是1并且X是Cl或Br) 可以通过在紫外线的存在下在55℃与100℃之间的温度下在合适的溶剂 (例如四氯甲烷) 中用卤素源 (例如N-溴代琥珀酰亚胺 (NBS) 或N-氯代琥珀酰亚胺 (NCS)) 和自由基引发剂 (例如 (PhCO<sub>2</sub>)<sub>2</sub> 或偶氮二异丁腈 (AIBN)) 进行处理从具有式 (XI) 的化合物制备。对于相关实例, 参见Liu, S. 等人. *Synthesis [合成]* (2001), 14, 2078和Kompella, A. 等人 *Org. Proc. Res. Dev. [有机加工研究与开发]* (2012), 16, 1794。该反应示于方案8中。



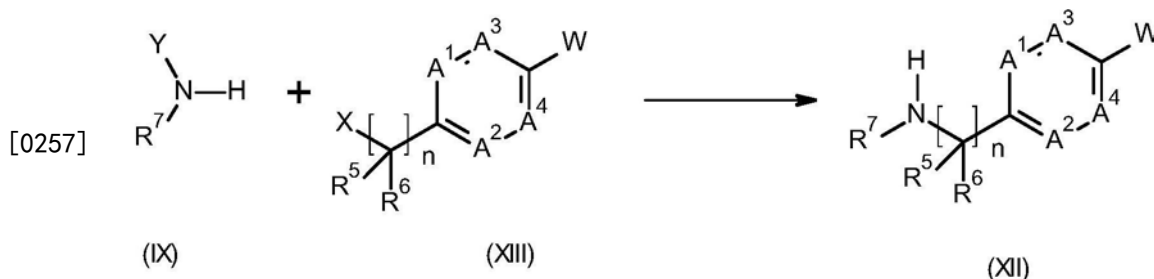
[0252] 方案8

[0253] 具有式 (VIII) 的化合物可以通过在合适的溶剂 (例如二氯甲烷) 中, 优选在0℃与25℃之间的温度下, 并且任选地在碱 (例如三乙胺或吡啶) 的存在下, 或在文献中描述的酰胺偶联条件下, 具有式 (XII) 的化合物和具有式 (III) 的化合物的偶联转化获得。例如, 参见 W02012/068251或Oshima, T. 等人. *Angew. Chem., Int. Ed [应用化学国际版]* (2015), 54, 7193。此外, 具有式 (III) 的化合物和具有式 (XII) 的化合物可商购获得或可使用已知方法制备。该反应示于方案9中。



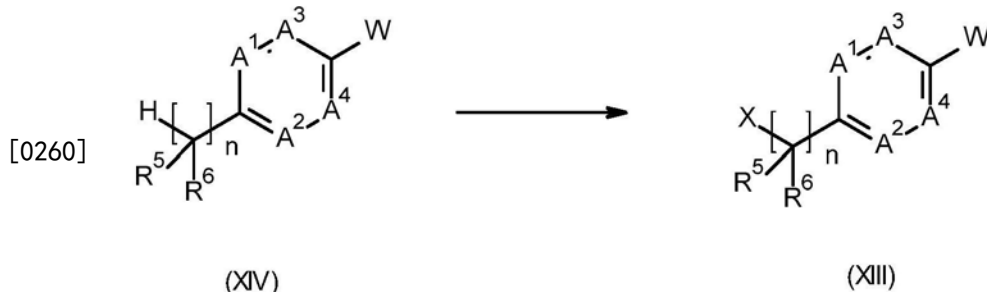
## [0255] 方案9

[0256] 可替代地,具有式 (XII) 的化合物(其中n优选是1)可以通过在25°C与60°C之间的温度下在合适的溶剂(例如,四氢呋喃)中用具有式 (IX) 的胺(其中Y是氢或叔丁基甲酸酯)进行处理从具有式 (XIII) 的化合物(其中X是Cl或Br并且W是Br、I或CN)制备。在合适的溶剂(例如,二噁烷或MeOH)中用HCl或三氟乙酸处理后,除去叔丁基甲酸酯基团并伴随释放具有式 (II) 的苄胺。对于相关实例,参见Miyawaki, K. 等人, *Heterocycles* [杂环] (2001), 54, 887、WO 2003/028729和WO 2013/066839。该反应示于方案10中。



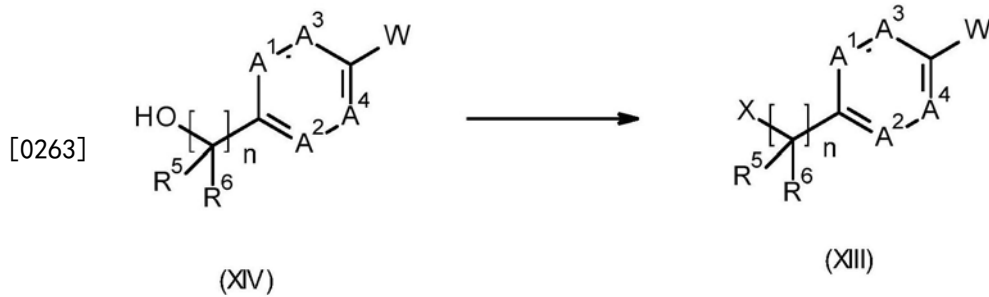
## [0258] 方案10

[0259] 具有式 (XIII) 的化合物(其中W是Br、I或CN且X是Cl或Br且n优选是1)是可商购的,或者可以通过在55°C与100°C之间的温度下在合适的溶剂(如四氯甲烷)中在紫外线的存在下用卤素源(例如,N-溴代琥珀酰亚胺(NBS)或N-氯代琥珀酰亚胺(NCS))和自由基引发剂(如 $(\text{PhCO}_2)_2$ 或偶氮二异丁腈(AIBN))进行处理从具有式 (XIV) 的化合物制备。对于相关实例,参见Liu, S. 等人, *Synthesis* [合成] (2001), 14, 2078和Kompella, A. 等人 *Org. Proc. Res. Dev.* [有机加工研究与开发] (2012), 16, 1794。该反应示于方案11中。



## [0261] 方案11

[0262] 可替代地,具有式 (XIII) 的化合物(其中X是Cl、Br、I或 $-\text{OSO}_2\text{Me}$ 且Z是Br、I或CN且n优选是1)是可商购的,或者可以通过在0°C与100°C之间的温度下在合适的溶剂(例如,二氯甲烷)中在三苯基膦的存在下用卤素源(例如, $\text{CBr}_4$ 、 $\text{CCl}_4$ 或 $\text{I}_2$ )进行处理或者用甲磺酰氯( $\text{ClSO}_2\text{Me}$ )进行处理从具有式 (XX) 的化合物制备。对于相关实例,参见Liu, H. 等人 *Bioorg. Med. Chem.* [生物有机与药物化学] (2008), 16, 10013、WO 2014/020350和Kompella, A. 等人 *Bioorg. Med. Chem. Lett* [生物有机与药物化学快报] (2001), 1, 3161。具有式 (XIV) 的化合物是可商购的。该反应示于方案12中。



[0264] 方案12

[0265] 如已指示的,出人意料地,现在已经发现,为实际目的,本发明的具有式(I)的化合物有着非常有利水平的用来保护植物免受由真菌引起的疾病的生物活性。

[0266] 可以在农业部门和相关领域中使用具有式(I)的化合物,用作例如用于控制植物有害生物的活性成分,或者在非生命材料上使用用于控制腐败微生物或对人潜在有害的有机体。这些新颖化合物的特征是施用比率低但活性高,植物耐受良好以及不危害环境。它们有非常有效的治疗的、预防的和系统性的特性并且可以用于保护无数栽培植株。具有式(I)的化合物可以用于抑制或破坏在不同的有用植物作物的植物或植物部分(果实、花、叶子、茎、块茎、根)上出现的有害生物,而同时还保护了稍后生长的那些植物部分免于例如植物病原性微生物的侵害。

[0267] 本发明进一步涉及用于通过处理植物或植物繁殖材料和/或收获的粮食作物来控制或预防易受微生物攻击的植物或植物繁殖材料和/或收获的食物作物的侵染的方法,其中将有效量的具有式(I)的化合物施用于所述植物、其部分或其场所。

[0268] 还能使用具有式(I)的化合物作为杀真菌剂。如本文使用的,术语“杀真菌剂”意指控制、修饰或预防真菌生长的化合物。术语“杀真菌有效量”在使用时意指能够对真菌生长产生影响的此种化合物或此类化合物的组合的量。控制或修饰的影响包括所有从自然发育的偏离,如杀死、阻滞等,并且预防包括在植物内或上面预防真菌感染的屏障或其他防御构造。

[0269] 还可以能够使用具有式(I)的化合物作为用于处理植物繁殖材料(例如,种子,如果实、块茎或谷粒)或植物插条的拌种剂,用于保护对抗真菌感染连同对抗土壤里存在的植物病原性真菌。可以在种植前用包含具有式(I)的化合物的组合物处理繁殖材料:例如可以在播种前拌种。还可以通过在液体配制品中浸渍种子或通过用固体配制品包衣它们,将具有式(I)的活性化合物施用至谷粒(包衣)。还可以在种植繁殖材料时,将组合物施用至种植位点,例如在播种期间施用至种子的犁沟。本发明还涉及处理植物繁殖材料的这样的方法,并且涉及如此处理的植物繁殖材料。

[0270] 此外,具有式(I)的化合物可以在相关领域中用于控制真菌,例如用于工业材料(包括木材以及与木材有关的工业产品)保护、食品储存、卫生管理。

[0271] 此外,本发明可以用于保护非生命材料(例如木料、墙板和涂漆)免受真菌攻击。

[0272] 具有式(I)的化合物例如针对疾病的真菌和真菌载体以及植物病原性细菌和病毒是有效的。这些疾病的真菌和真菌载体以及植物病原性细菌和病毒是例如:

[0273] 伞枝梨头霉、链格孢属物种、丝囊霉属物种、壳二孢属物种、曲霉属物种(包括黄曲霉、烟曲霉、构巢曲霉、黑曲霉、土曲霉)、短梗霉属物种(包括出芽短梗霉(*A. pullulans*))、



皮炎芽生菌、小麦白粉病菌、莴苣盘梗霉 (*Bremia lactucae*)、葡萄座腔菌属物种 (包括葡萄溃疡病菌 (*B.dothidea*)、树花地衣葡萄座腔菌 (*B.obtusa*))、葡萄孢属物种 (包括灰葡萄孢 (*B.cinerea*))、念珠菌属物种 (包括白色念珠菌、光滑球念珠菌 (*C.glabrata*)、克鲁斯念珠菌 (*C.krusei*)、葡萄牙念珠菌 (*C.lusitaniae*)、近平滑念珠菌 (*C.parapsilosis*)、热带念珠菌 (*C.tropicalis*))、Cephalosporium fragrans、长喙壳属物种、尾孢属物种 (包括褐斑病菌 (*C.arachidicola*))、晚斑病菌 (*Cercosporidium personatum*)、枝孢霉属物种、麦角菌、粗球孢子菌、旋孢腔菌属物种、炭疽菌属物种 (包括香蕉炭疽病菌 (*C.musae*))、新型隐球菌、间座壳属 (*Diaporthe*) 物种、亚隔孢壳属物种、内脐蠕孢属物种、痂囊腔菌属物种、表皮癣菌属物种、梨火疫病菌、白粉菌属物种 (包括菊科白粉菌 (*E.cichoracearum*))、葡萄顶枯病菌 (*Eutypa lata*)、镰刀菌属物种 (包括大刀镰刀菌、禾谷镰刀菌、*F.langsethiae*、串珠镰刀菌、胶孢镰刀菌、茄病镰刀菌、尖孢镰刀菌、层出镰刀菌)、小麦全蚀病菌 (*Gaeumannomyces graminis*)、藤仓赤霉菌 (*Gibberella fujikuroi*)、煤烟病菌 (*Gloeodes pomigena*)、香蕉炭疽盘长孢菌 (*Gloeosporium musarum*)、苹果炭疽病菌 (*Glomerella cingulate*)、葡萄球座菌 (*Guignardia bidwellii*)、植物受桧胶锈菌 (*Gymnosporangium juniperi-virginiana*)、长蠕孢属物种、驼孢锈菌属物种、组织胞浆菌属物种 (包括荚膜组织胞浆菌 (*H.capsulatum*))、红线病菌、*Leptographium lindbergi*、辣椒白粉病菌 (*Leveillula taurica*)、松针散盘壳 (*Lophodermium seditiosum*)、雪霉叶枯菌 (*Microdochium nivale*)、小孢子菌属物种、链核盘菌属物种、毛霉属物种、球腔菌属物种 (包括禾生球腔菌、苹果黑点病菌 (*M.pomi*))、树梢枯病菌、云杉病菌、副球孢子菌属物种、青霉属物种 (包括指状青霉、意大利青霉)、霉样真霉属物种、指霜霉属物种 (包括玉蜀黍指霜霉、菲律宾霜指霉和高粱指霜霉)、霜霉属物种、颖枯壳针孢、豆薯层锈菌、桑黄火木针层孔菌 (*Phellinus igniarius*)、瓶霉属物种、茎点霉属物种、葡萄生拟茎点菌 (*Phomopsis viticola*)、疫霉菌属物种 (包括致病疫霉菌)、单轴霉属物种 (包括霍尔单轴霉菌、葡萄霜霉病菌 (*P.viticola*))、格孢腔菌属物种、叉丝单囊壳属物种 (包括白叉丝单囊壳 (*P.leucotricha*))、禾谷多粘菌 (*Polymyxa graminis*)、甜菜多粘菌 (*Polymyxa betae*)、小麦基腐病菌 (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、假单胞菌属物种、假霜霉属物种 (包括黄瓜霜霉病菌、茛苳假霜霉)、*Pseudopeziza tracheiphila*、霜霉属物种 (包括大麦柄锈菌 (*P.hordei*)、小麦叶锈病菌 (*P.recondita*)、条形柄锈菌 (*P.Striiformis*)、小麦褐锈菌 (*P.triticina*))、埋核盘菌属物种、核腔菌属物种、梨孢属物种 (包括稻瘟病菌 (*P.oryzae*))、腐霉属物种 (包括终极腐霉菌)、柱隔孢属物种、丝核菌属物种、微小根毛霉 (*Rhizomucor pusillus*)、少根根霉、喙孢属物种、丝孢菌属物种 (包括尖端赛多孢子菌和多育赛多孢子菌)、煤点病 (*Schizothyrium pomi*)、核盘菌属物种、小核菌属物种、壳针孢属物种 (包括颖枯壳针孢 (*S.nodorum*)、小麦壳针孢 (*S.tritici*))、草莓白粉病菌 (*Sphaerotheca macularis*)、棕丝单囊壳 (*Sphaerotheca fusca*) (黄瓜白粉病菌 (*Sphaerotheca fuliginea*))、孢子丝菌属 (*Sporothrix*) 物种、颖枯壳多孢 (*Stagonospora nodorum*)、匍柄霉属 (*Stemphylium*) 物种、毛韧革菌 (*Stereum hirsutum*)、水稻枯纹病菌 (*Thanatephorus cucumeris*)、根串珠霉 (*Thielaviopsis basicola*)、腥黑粉菌属物种、木霉属物种 (包括哈茨木霉、拟康氏木霉、绿色木霉)、毛癣菌属物种、核瑚菌属物种、葡萄钩丝壳、条黑粉菌属 (*Urocystis*) 物种、黑粉菌属 (*Ustilago*) 物种、黑星菌属物种 (包括苹果黑星菌

(*V. inaequalis*))、轮枝孢属物种、以及黄单胞菌属物种。

[0274] 具有式(I)的化合物可以用于例如草坪,观赏植物如花卉、灌木、阔叶树木或常绿植物,例如松柏类,以及树木注入、有害生物管理等。

[0275] 在本发明的范围内,有待保护的目标作物和/或有用植物典型地包括多年生和一年生作物,如浆果植物,例如黑莓、蓝莓、蔓越莓、树莓以及草莓;谷类,例如大麦、玉米(maize或corn)、小米、燕麦、水稻、黑麦、高粱、黑小麦以及小麦;纤维植物,例如棉花、亚麻、大麻、黄麻和剑麻;大田作物,例如糖甜菜和饲料甜菜、咖啡豆、啤酒花、芥菜、油菜(卡诺拉)、罌粟、甘蔗、向日葵、茶以及烟草;果树,例如苹果、杏、鳄梨、香蕉、樱桃、柑橘、油桃、桃、梨以及李子;草,例如百慕达草、蓝草、本特草、蜈蚣草、牛毛草、黑麦草、圣奥古斯丁草以及结缕草;药草,如罗勒、琉璃苣、细香葱、胡荽、薰衣草、独活草、薄荷、牛至、荷兰芹、迷迭香、鼠尾草以及百里香;豆类,例如菜豆、小扁豆、豌豆和大豆;坚果,例如杏仁、腰果、落花生、榛子、花生、山核桃、开心果和核桃;棕榈植物,例如油棕榈;观赏植物,例如花、灌木和树;其他树木,例如可可、椰子、橄榄和橡胶;蔬菜,例如芦笋、茄子、西兰花、卷心菜、胡萝卜、黄瓜、大蒜、莴苣、西葫芦、甜瓜、秋葵、洋葱、胡椒、马铃薯、南瓜、大黄、菠菜和番茄;和葡萄藤,例如葡萄。

[0276] 术语“有用植物”应当理解为还包括由于常规育种或基因工程方法已经致使其对除草剂(像溴草腈)或除草剂类(例如像HPPD抑制剂、ALS抑制剂,例如氟嘧磺隆、氟丙磺隆和三氟啶磺隆、EPSPS(5-烯醇-丙酮-莽草酸-3-磷酸-合成酶)抑制剂、GS(谷氨酰胺合成酶)抑制剂或PPO(原卟啉原氧化酶)抑制剂)耐受的有用植物。已经通过常规育种方法(诱变)致使对咪唑啉酮(例如甲氧咪草烟)耐受的作物的实例是**Clearfield®**夏季油菜(卡诺拉)。已经通过基因工程方法致使对除草剂或除草剂类耐受的作物的实例包括草甘膦和草丁膦抗性玉米品种,它们以**RoundupReady®**、**Herculex I®**和**LibertyLink®**商标名可商购。

[0277] 术语“有用植物”应当理解为还包括已经通过使用重组DNA技术而被这样转化使其能够合成一种或多种选择性作用毒素的有用植物,这些毒素是如已知例如来自于产毒素细菌,尤其是芽孢杆菌属的那些细菌。

[0278] 此类植物的实例是:**YieldGard®**(玉米品种,表达CryIA(b)毒素);**YieldGard Rootworm®**(玉米品种,表达CryIIIB(b1)毒素);**YieldGard Plus®**(玉米品种,表达CryIA(b)和CryIIIB(b1)毒素);**Starlink®**(玉米品种,表达Cry9(c)毒素);**Herculex I®**(玉米品种,表达CryIF(a2)毒素和获得对除草剂草铵膦的耐受性的酶膦丝菌素N-乙酰基转移酶(PAT));**NuCOTN 33B®**(棉花品种,表达CryIA(c)毒素);**Bollgard I®**(棉花品种,表达CryIA(c)毒素);**Bollgard II®**(棉花品种,表达CryIA(c)和CryIIA(b)毒素);**VIPcot®**(棉花品种,表达VIP毒素);**NewLeaf®**(马铃薯品种,表达CryIIIA毒素);**NatureGard® Agrisure®GT Advantage**(GA21耐草甘膦性状)、**Agrisure®CB Advantage**(Bt11玉米螟(CB)性状)、**Agrisure®RW**(玉米根虫性状)以及**Protecta®**。

[0279] 术语“作物”应当理解为还包括已经通过使用重组DNA技术而被这样转化使其能够

合成一种或多种选择性作用毒素的作物植物,这些毒素是如已知例如来自于产毒素细菌,尤其是芽孢杆菌属的那些细菌。

[0280] 可由此类转基因植物表达的毒素包括例如,来自蜡样芽胞杆菌或日本金龟子芽孢杆菌的杀昆虫蛋白;或者来自苏云金芽孢杆菌的杀昆虫蛋白,如 $\delta$ -内毒素,例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C,或者营养期杀昆虫蛋白(Vip),例如Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A;或细菌定植线虫的杀昆虫蛋白,例如光杆状菌属某些种(*Photorhabdus* spp.)或致病杆菌属某些种(*Xenorhabdus* spp.),如发光杆菌(*Photorhabdus luminescens*)、嗜线虫致病杆菌(*Xenorhabdus nematophilus*);由动物产生的毒素,如蝎毒素、蛛毒素、蜂毒素和其他昆虫特异性神经毒素;由真菌产生的毒素,如链霉菌毒素,植物凝集素类(lectin),如豌豆凝集素、大麦凝集素或雪花莲凝集素;凝集素类(agglutinin);蛋白酶抑制剂,如胰蛋白酶抑制剂、丝蛋白酶抑制剂、马铃薯糖蛋白、胰抑素、木瓜蛋白酶抑制剂;核糖体失活蛋白(RIP),如蓖麻毒素、玉米-RIP、相思豆毒素、丝瓜籽蛋白、皂草素或异株泻根毒蛋白;类固醇代谢酶,如3-羟基类固醇氧化酶、蜕化类固醇-UDP-糖基-转移酶、胆固醇氧化酶、蜕化素抑制剂、HMG-COA-还原酶、离子通道阻断剂如钠通道或钙通道阻断剂、保幼激素酯酶、利尿激素受体、芪合酶、联苳合酶、几丁质酶和葡聚糖酶。

[0281] 进一步地,在本发明的上下文下, $\delta$ -内毒素(例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C)或营养期杀虫蛋白(Vip)(例如Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A)应理解为显然还包括混合型毒素、截短的毒素和经修饰的毒素。混合型毒素是通过那些蛋白的不同结构域的新组合重组产生的(参见例如,W002/15701)。截短的毒素,例如截短的Cry1Ab是已知的。在经修饰的毒素的情况下,天然存在的毒素的一个或多个氨基酸被置换。在这种氨基酸置换中,优选将非天然存在的蛋白酶识别序列插入毒素中,例如像在Cry3A055的情况下,组织蛋白酶-G-识别序列被插入Cry3A毒素中(参见W0 03/018810)。

[0282] 这样的毒素或能够合成这样的毒素的转基因植物的实例披露于例如EP-A-0 374 753、W0 93/07278、W0 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451 878以及W0 03/052073中。

[0283] 用于制备此类转基因植物的方法通常是本领域技术人员已知的并且描述在例如以上提及的公开物中。CryI型脱氧核糖核酸及其制备例如从W0 95/34656、EP-A-0 367 474、EP-A-0 401 979和W0 90/13651中已知。

[0284] 包含在转基因植物中的毒素使得植物对有害昆虫有耐受性。这些昆虫可以存在于任何昆虫分类群,但尤其是通常在甲虫(鞘翅目)、双翅昆虫(双翅目)以及蝴蝶(鳞翅目)中发现。

[0285] 含有一种或多种编码杀昆虫剂抗性并且表达一种或多种毒素的基因的转基因植物是已知的并且其中一些是可商购的。此类植物的实例是:**YieldGard®**(玉米品种,表达Cry1Ab毒素);**YieldGard Rootworm®**(玉米品种,表达Cry3Bb1毒素);**YieldGard Plus®**(玉米品种,表达Cry1Ab和Cry3Bb1毒素);**Starlink®**(玉米品种,表达Cry9C毒素);**Herculex I®**(玉米品种,表达Cry1Fa2毒素和获得对除草剂草铵膦的耐受性的酶膦丝菌素N-乙酰基转移酶(PAT));**NuCOTN 33B®**(棉花品种,表达Cry1Ac毒素);**Bollgard I®**(棉花品种,表达Cry1Ac毒素);**Bollgard II®**(棉花品种,表达Cry1Ac和Cry2Ab毒素);

**VipCot®** (棉花品种,表达Vip3A和Cry1Ab毒素); **NewLeaf®** (马铃薯品种,表达Cry3A毒素); **NatureGard®**、**Agrisure®** GT Advantage (GA21耐草甘膦性状)、**Agrisure®** CB Advantage (Bt11玉米螟 (CB) 性状) 以及 **Protecta®**。

[0286] 此类转基因作物的另外的实例是:

[0287] 1. Bt11玉米,来自先正达种子子公司 (Syngenta Seeds SAS), 霍比特路 (Chemin de l' Hobit) 27, F-31 790 圣苏维尔 (St. Sauveur), 法国, 登记号 C/FR/96/05/10。遗传修饰的玉蜀黍, 已经通过转基因表达截短的Cry1Ab毒素, 使之能抵抗欧洲玉米螟 (玉米螟和粉茎螟) 的侵袭。Bt11玉米还转基因表达PAT酶以获得对除草剂草铵膦的耐受性。

[0288] 2. Bt176玉米,来自先正达种子子公司, 霍比特路27, F-31 790 圣苏维尔, 法国, 登记号 C/FR/96/05/10。遗传修饰的玉蜀黍, 通过转基因表达Cry1Ab毒素, 使之能抵抗欧洲玉米螟 (玉米螟和粉茎螟) 的侵袭。Bt176玉米还转基因表达酶PAT以获得对除草剂草铵膦的耐受性。

[0289] 3. MIR604玉米,来自先正达种子子公司, 霍比特路27, F-31 790 圣苏维尔, 法国, 登记号 C/FR/96/05/10。通过转基因表达经修饰的Cry3A毒素使之具有昆虫抗性的玉米。该毒素是通过插入组织蛋白酶-G-蛋白酶识别序列而经修饰的Cry3A055。此类转基因玉米植物的制备描述于W0 03/018810中。

[0290] 4. MON 863玉米,来自孟山都欧洲公司 (Monsanto Europe S.A.), 270-272特弗伦大道 (Avenue de Tervuren), B-1150布鲁塞尔, 比利时, 登记号 C/DE/02/9。MON 863表达Cry3Bb1毒素, 并且对某些鞘翅目昆虫有抗性。

[0291] 5. IPC 531棉花,来自孟山都欧洲公司 (Monsanto Europe S.A.), 270-272特弗伦大道 (Avenue de Tervuren), B-1150布鲁塞尔, 比利时, 登记号 C/ES/96/02。

[0292] 6. 1507玉米,来自先锋海外公司 (Pioneer Overseas Corporation), 特德斯科大 道 (Avenue Tedesco), 7B-1160布鲁塞尔, 比利时, 登记号 C/NL/00/10。遗传修饰的玉米, 表达蛋白质Cry1F以获得对某些鳞翅目昆虫的抗性, 并且表达PAT蛋白质以获得对除草剂草铵膦的耐受性。

[0293] 7. NK603×MON 810玉米,来自孟山都欧洲公司 (Monsanto Europe S.A.), 270-272特弗伦大道 (Avenue de Tervuren), B-1150布鲁塞尔, 比利时, 登记号 C/GB/02/M3/03。通过将遗传修饰的品种NK603和MON 810杂交, 由常规育种的杂交玉米品种构成。NK603×MON810玉米转基因地表达由土壤杆菌属物种菌株CP4获得的蛋白质CP4EPS (使之耐除草剂 **Roundup®** (含有草甘膦)), 以及还有由苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*) 获得的Cry1Ab毒素 (使之耐某些鳞翅目昆虫, 包括欧洲玉米螟)。

[0294] 根据本发明的具有式 (I) 化合物 (包括表T1 (下文) 中列出的化合物1.1至1.112, 表T2 (下文) 中列出的化合物2.1至2.39, 表T3 (下文) 中列出的化合物3.1至3.36, 或表T4 (下文) 中列出的化合物4.1至4.2) 可用于控制或预防植物病原性疾病, 尤其是大豆植物上的植物病原性真菌 (例如豆薯层锈菌)。

[0295] 具体地, 表达毒素例如杀虫蛋白如 $\delta$ -内毒素 (例如Cry1Ac (Cry1Ac Bt蛋白)) 的转基因大豆植物。相应地, 这可以包括包含事件MON87701 (参见美国专利号8,049,071以及相

关申请和专利,以及WO 2014/170327A1(例如参见参考Intacta RR2PRO™大豆的段落[008]))、事件MON87751(美国专利申请公开号2014/0373191)或事件DAS-81419(美国专利号8632978以及相关申请和专利)的转基因大豆植物。

[0296] 其他转基因大豆植物可以包含事件SYHT0H2-HPPD耐受性(美国专利申请公开号2014/0201860以及相关申请和专利)、事件MON89788-草甘膦耐受性(美国专利号7,632,985以及相关申请和专利)、事件MON87708-麦草畏耐受性(美国专利申请公开号US 2011/0067134以及相关申请和专利)、事件DP-356043-5-草甘膦以及ALS耐受性(美国专利申请公开号US 2010/0184079以及相关申请和专利)、事件A2704-12-草铵膦耐受性(美国专利申请公开号US 2008/0320616以及相关申请和专利)、事件DP-305423-1-ALS耐受性(美国专利申请公开号US 2008/0312082以及相关申请和专利)、事件A5547-127-草铵膦耐受性(美国专利申请公开号US 2008/0196127以及相关申请和专利)、事件DAS-40278-9-对2,4-二氯苯氧基乙酸和芳氧基苯氧基丙酸酯的耐受性(参见WO 2011/022469、WO 2011/022470、WO 2011/022471、以及相关申请和专利)、事件127-ALS耐受性(WO 2010/080829以及相关申请和专利)、事件GTS 40-3-2-草甘膦耐受性、事件DAS-68416-4-2,4-二氯苯氧基乙酸以及草铵膦耐受性、事件FG72-草甘膦和异噁唑草酮耐受性、事件BPS-CV127-9-ALS耐受性以及GU262-草铵膦耐受性或事件SYHT04R-HPPD耐受性。

[0297] 在某些情况下,根据本发明的具有式(I)的化合物在用于控制或预防植物病原性疾病、尤其是大豆植物(特别是如上所述的任何转基因大豆植物)上的植物病原性真菌(如豆薯层锈菌)时,可显示活性成分之间的协同相互作用。

[0298] 如本文使用的,术语“场所”意指植物在其中或其上生长的地方,或栽培植物的种子被播种的地方,或者种子将要被置于土壤中的地方。它包括土壤、种子以及幼苗,连同建立的植被。

[0299] 术语“植物”是指植物的所有有形部分,包括种子、幼苗、幼树、根、块茎、茎、秆、叶和果实。

[0300] 术语“植物繁殖材料”应当被理解为表示该植物的生殖部分,如种子,这些部分可以用于该植物的繁殖,以及营养性材料,例如插条或块茎(例如马铃薯)。可以提及例如种子(在严格意义上)、根、果实、块茎、球茎、根茎以及植物的部分。还可以提及在发芽后或破土后将移发的发芽植物和幼小植物。这些幼小植物可以通过浸渍进行完全或部分处理而在移植之前进行保护。优选地,“植物繁殖材料”应当理解为表示种子。

[0301] 具有式(I)的化合物能以未修饰的形式使用,或者优选地,连同配制品领域中常规使用的佐剂一起使用。为此目的,它们可以按已知方式便利地配制为可乳化浓缩物、可包衣的糊剂、直接可喷雾的或可稀释的溶液或悬浮液、稀释乳液、可湿性粉剂、可溶性粉剂、尘剂、颗粒以及还有封装物,例如封装在聚合物物质中。对于这些组合物的类型,根据预期的目的以及盛行环境来选择施用方法,如喷洒、雾化、撒粉、播散、包衣或倾倒。这些组合物还可以含有另外的佐剂,如稳定剂、消泡剂、粘度调节剂、粘合剂或增粘剂,以及肥料、微量营养素供体或其他用于获得特殊效果的配制品。

[0302] 合适的载体以及佐剂,例如对于农业用途,可以是固体或液体的并且是在配制品技术中有用的物质,例如天然或再生的矿物物质,溶剂、分散体、湿润剂、增粘剂、增稠剂、粘合剂或肥料类。此类载体例如描述在WO 97/33890中。

[0303] 悬浮液浓缩物是活性化合物的精细分散的固体颗粒悬浮于其中的水性配制品。此类配制品包括抗沉降剂和分散剂,并且可以进一步包括湿润剂,以增强活性,以及消泡剂和晶体生长抑制剂。在使用时,将这些浓缩物在水中稀释,并且通常作为喷雾剂施用至有待处理的区域。活性成分的量的范围可以是该浓缩物的0.5%至95%。

[0304] 可湿性粉剂是处于在水中或其他液态载体中容易分散的精细分散的颗粒形式。这些颗粒含有保存在固体基质里的活性成分。典型的固体基质包括漂白土、高岭土、硅石和其他容易湿化的有机或无机固体。可湿性粉剂通常含有从5%至95%的活性成分加上少量的润湿剂、分散剂或乳化剂。

[0305] 可乳化浓缩物是在水中或其他液体中可分散的均匀的液体组合物并且可以完全由活性化合物与液体或固体乳化剂组成,或者还可以含有液态载体,如二甲苯、重芳族石脑油、异佛尔酮和其他不挥发有机溶剂。在使用时,将这些浓缩物分散在水中或其他液体中,并且通常作为喷雾剂施用至有待处理的区域。活性成分的量的范围可以是该浓缩物的0.5%至95%。

[0306] 颗粒配制品包括挤出物和较粗颗粒两者,并且通常不用稀释地施用至需要处理的区域。用于颗粒配制品的典型载体包括沙、漂白土、凹凸棒石粘土、膨润土、蒙脱土、蛭石、珍珠岩、碳酸钙、砖、浮石、叶蜡石、高岭土、白云石、灰泥、木粉、碎玉米穗轴、碎花生壳、糖、氯化钠、硫酸钠、硅酸钠、硼酸钠、氧化镁、云母、氧化铁、氧化锌、氧化钛、氧化锑、冰晶石、石膏、硅藻土、硫酸钙以及其他有机或无机的吸收活性化合物或被活性化合物包衣的材料。颗粒配制品通常含有5%至25%的活性组分,这些成分可包括表面活性剂例如重芳烃挥发油、煤油和其他石油馏分,或植物油;和/或粘着剂如糊精、胶或合成树脂。

[0307] 尘剂是活性成分与精细分散的固体(如滑石、粘土、面粉以及其他有机与无机的作为分散剂和载体的固体)的可自由流动的混合物。

[0308] 微胶囊典型地是包裹在惰性多孔壳内的活性成分的微滴或颗粒,该惰性多孔壳允许以可控的速率让包住的材料逃逸到环境中。封装的微滴的直径典型地为1微米到50微米。包裹的液体典型地构成胶囊重量的50%至95%并且除了活性化合物外还可以包括溶剂。封装的颗粒通常是多孔颗粒,其中多孔膜将颗粒孔口密封,从而将活性种类以液体形式保存在颗粒孔内部。颗粒的直径的范围典型地是从1毫米至1厘米并且优选地1毫米至2毫米。颗粒通过挤出、凝聚或成球形成,或者是天然存在的。这样的材料的实例为蛭石、烧结粘土、高岭土、凹凸棒石粘土、锯屑和碳精粒。壳或膜材料包括天然和合成橡胶、纤维材料、苯乙烯-丁二烯共聚物、聚丙烯腈、聚丙烯酸酯、聚酯、聚酰胺、聚脲、聚氨酯和淀粉黄原酸酯。

[0309] 用于农用化学应用的其他有用配制品包括活性成分在溶剂(如丙酮、烷基化苯、二甲苯和其他有机溶剂)中的简单溶液,在该溶剂中活性成分以所希望的浓度完全溶解。也可以使用加压的喷雾剂,其中由于低沸点分散剂溶剂载体的蒸发活性成分以精细分散的形式分散。

[0310] 在上述配制品类型中对于配制本发明的组合物有用的合适的农用佐剂和载体是本领域的技术人员众所周知的。

[0311] 可以利用的液态载体包括例如水、甲苯、二甲苯、石脑油、作物油、丙酮、甲基乙基酮、环己酮、乙酸酐、乙腈、乙酰苯、乙酸戊酯、2-丁酮、氯苯、环己烷、环己醇、乙酸烷基酯、二丙酮醇、1,2-二氯丙烷、二乙醇胺、对-二乙基苯、二甘醇、松香酸二甘醇酯、二甘醇丁醚、二

甘醇乙醚、二甘醇甲醚、N,N-二甲基甲酰胺、二甲基亚砷、1,4-二噁烷、二丙二醇、二丙二醇甲醚、二丙二醇二苯甲酸酯、二丙二醇(diproxitol)、烷基吡咯烷酮、乙酸乙酯、2-乙基己醇、碳酸亚乙酯、1,1,1-三氯乙烷、2-庚酮、 $\alpha$ -蒎烯、d-蒎烯、乙二醇、乙二醇丁醚、乙二醇甲醚、 $\gamma$ -丁内酯、甘油、甘油二乙酸酯、甘油单乙酸酯、甘油三乙酸酯、十六烷、己二醇、乙酸异戊酯、乙酸异冰片酯、异辛烷、异佛尔酮、异丙苯、肉豆蔻酸异丙酯、乳酸、月桂胺、异丙叉丙酮、甲氧基丙醇、甲基异戊酮、甲基异丁基酮、月桂酸甲酯、辛酸甲酯、油酸甲酯、二氯甲烷、间二甲苯、正己烷、正辛胺、十八酸、乙酸辛胺酯、油酸、油胺、邻二甲苯、苯酚、聚乙二醇(PEG400)、丙酸、丙二醇、丙二醇单甲醚、对二甲苯、甲苯、磷酸三乙酯、三甘醇、二甲苯磺酸、石蜡、矿物油、三氯乙烯、全氯乙烯、乙酸乙酯、乙酸戊酯、乙酸丁酯、甲醇、乙醇、异丙醇、以及更高分子量的醇类如戊醇、四氢糠醇、己醇、辛醇等,乙二醇、丙二醇、甘油以及N-甲基-2-吡咯烷酮。水通常是用以稀释浓缩物的选用载体。

[0312] 合适的固体载体包括例如滑石、二氧化钛、叶腊石粘土、硅石、凹凸棒石粘土、硅藻土(kieselguhr)、白垩、硅藻土(diatomaceous earth)、石灰、碳酸钙、膨润土、漂白土、棉子壳、小麦粉、大豆粉、浮石、木粉、核桃壳粉以及木质素。

[0313] 在所述液体和固体组合物中可有利地采用广泛的表面活性剂,尤其是被设计为可在施用前用载体稀释的那些。这些试剂在使用时通常按重量计组成配制品的从0.1%至15%。它们在性质上可以是阴离子的、阳离子的、非离子的或聚合的并且可以作为乳化剂、润湿剂、悬浮剂或以其他目的采用。典型的表面活性剂包括烷基硫酸盐,如月桂基硫酸二乙醇铵;烷基芳基磺酸盐,如十二烷基苯磺酸钙;烷基酚/氧化烯加成产物,如壬基苯酚-C.sub.18乙氧基化物;醇-氧化烯加成产物,如十三烷醇-C.sub.16乙氧基化物;皂,如硬脂酸钠;烷基萘磺酸盐,如二丁基萘磺酸钠;磺基丁二酸二烷基酯的盐,如二(2-乙基己基)磺基丁二酸钠;山梨糖醇酯,如山梨糖醇油酸酯;季胺类,如月桂基三甲基氯化铵;脂肪酸的聚氧乙烯酯,如聚乙二醇硬脂酸酯;环氧乙烷和环氧丙烷的嵌段共聚物;以及磷酸单和二烷基酯的盐。

[0314] 通常在农业组合物中使用的其他佐剂包括结晶抑制剂、粘度调节剂、悬浮剂、喷雾液滴改性剂、颜料、抗氧化剂、发泡剂、防泡剂、遮光剂、相容性试剂、消泡剂、掩蔽剂、中和剂和缓冲剂、腐蚀抑制剂、染料、增味剂、铺展剂、渗透助剂、微量营养素、柔润剂、润滑剂以及粘着剂。

[0315] 此外,进一步地,其他杀生物的活性成分或组合物可以与本发明的组合物组合,并且用于本发明的方法中并且同时地或顺序地随着本发明的组合物施用。当同时施用时,这些另外的活性成分可以连同本发明的组合物一起配制或混合于例如喷雾罐中。这些另外的杀生物的活性成分可以是杀真菌剂、除草剂、杀昆虫剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂和/或植物生长调节剂。

[0316] 本文提及的使用其通用名的杀有害生物剂是已知的,例如,从“The Pesticide Manual[杀有害生物剂手册]”,第15版,英国作物保护委员会(British Crop Protection Council)2009。

[0317] 此外,本发明的组合物还可以与一种或多种系统获得性抗性诱导剂(“SAR”诱导剂)一起施用。SAR诱导剂是已知的并且描述于例如美国专利号US 6,919,298中,并且包括例如水杨酸盐以及商业的SAR诱导剂阿拉酸式苯-S-甲基。

[0318] 具有式(I)的化合物通常以农用化学组合物的形式使用并且可以与另外的化合物同时地或顺序地施用至作物区域或有待处理的植物。例如,这些另外的化合物可以是影响植物生长的肥料或微量营养素供体或其他制剂。它们还可以是选择性除草剂或非选择性除草剂,连同杀昆虫剂、杀真菌剂、杀细菌剂、杀线虫剂、杀软体动物剂或几种这些制剂的混合物,如果希望的话连同配制品领域中通常使用的另外的载体、表面活性剂或促进施用的佐剂一起。

[0319] 具有式(I)的化合物可以按控制或保护对抗植物病原性微生物的(杀真菌的)组合物的形式使用,所述组合物包含至少一种具有式(I)的化合物或至少一种优选的如本文所定义的个别化合物作为活性成分(处于游离形式或处于农用化学上可用的盐形式)和上述佐剂中的至少一种。

[0320] 因此,本发明提供了包含至少一种具有式(I)的化合物、农业上可接受的载体和任选地佐剂的组合物,优选杀真菌组合物。农业上可接受的载体是例如适合农业用途的载体。农业载体在本领域是众所周知的。优选地,除了包含具有式(I)的化合物,所述组合物可以包含至少一种或多种杀有害生物活性化合物,例如另外的杀真菌活性成分。

[0321] 具有式(I)的化合物可以是组合物的唯一活性成分,或者适当时它可以与一种或多种另外的活性成分(如杀有害生物剂、杀真菌剂、增效剂、除草剂或植物生长调节剂)混合。在一些情况下,另外的活性成分会导致出人意料的协同活性。

[0322] 合适的另外的活性成分的实例包括以下项:无环氨基酸(acycloamino acid)杀真菌剂、脂肪族氮杀真菌剂、酰胺杀真菌剂、苯胺杀真菌剂、抗生素杀真菌剂、芳香族杀真菌剂、含砷杀真菌剂、芳基苯基酮杀真菌剂、苯甲酰胺杀真菌剂、苯甲酰苯胺杀真菌剂、苯并咪唑杀真菌剂、苯并噻唑杀真菌剂、植物杀真菌剂、桥联苯基杀真菌剂、氨基甲酸酯杀真菌剂、苯氨甲酸酯杀真菌剂、康唑杀真菌剂、铜杀真菌剂、二甲酰亚胺杀真菌剂、二硝基苯酚杀真菌剂、二硫代氨基甲酸酯杀真菌剂、二硫戊环杀真菌剂、糠酰胺杀真菌剂、糠苯胺杀真菌剂、酰肼真菌剂、咪唑杀真菌剂、汞杀真菌剂、吗啉杀真菌剂、有机磷杀真菌剂、有机锡杀真菌剂、氧硫杂环己二烯(oxathiin)杀真菌剂、噁唑杀真菌剂、苯硫酰胺杀真菌剂、多硫化物杀真菌剂、吡唑杀菌剂、吡啶杀真菌剂、嘧啶杀真菌剂、吡咯杀真菌剂、季铵杀真菌剂、喹啉杀真菌剂、醌杀真菌剂、喹啉杀真菌剂、嗜球果伞素杀真菌剂、磺酰苯胺(sulfonanilide)杀真菌剂、噻二唑杀真菌剂、噻唑杀真菌剂、噻唑烷杀真菌剂、硫代氨基甲酸酯杀真菌剂、噻吩杀真菌剂、三嗪杀真菌剂、三唑杀真菌剂、三唑并嘧啶杀真菌剂、尿素杀真菌剂、缬氨酰胺(valinamide)杀真菌剂、以及锌杀真菌剂。

[0323] 合适的另外的活性成分的实例还包括以下项:3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸(9-二氯亚甲基-1,2,3,4-四氢-1,4-桥亚甲基-萘-5-基)-酰胺、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸甲氧基-[1-甲基-2-(2,4,6-三氯苯基)-乙基]-酰胺、1-甲基-3-二氟甲基-1H-吡唑-4-甲酸(2-二氯亚甲基-3-乙基-1-甲基-茛满-4-基)-酰胺(1072957-71-1)、1-甲基-3-二氟甲基-1H-吡唑-4-甲酸(4'-甲基硫烷基-联苯基-2-基)-酰胺、1-甲基-3-二氟甲基-4H-吡唑-4-甲酸[2-(2,4-二氯-苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-酰胺、(5-氯-2,4-二甲基-吡啶-3-基)-(2,3,4-三甲氧基-6-甲基-苯基)-甲酮、(5-溴-4-氯-2-甲氧基-吡啶-3-基)-(2,3,4-三甲氧基-6-甲基-苯基)-甲酮、2-{2-[ (E)-3-(2,6-二氯-苯基)-1-甲基-丙-2-烯-(E)-亚基氨基氧基甲基]-苯基}-2-[ (Z)-甲氧基亚氨基]-N-甲基-乙酰胺、3-[5-(4-氯-苯



基)-2,3-二甲基-异噁唑烷-3-基]-吡啶、(E)-N-甲基-2-[2-(2,5-二甲基苯氧基甲基)苯基]-2-甲氧基-亚氨基乙酰胺、4-溴-2-氰基-N,N-二甲基-6-三氟甲基苯并咪唑-1-磺胺、 $\alpha$ -[N-(3-氯-2,6-二甲苯基)-2-甲氧基乙酰胺]- $\gamma$ -丁内酯、4-氯-2-氰基-N,N-二甲基-5-对甲苯基咪唑-1-磺胺、N-烯丙基-4,5-二甲基-2-三甲基甲硅烷基噻吩-3-甲酰胺、N-(1-氰基-1,2-二甲基丙基)-2-(2,4-二氯苯氧基)丙酰胺、N-(2-甲氧基-5-吡啶基)-环丙烷甲酰胺、(.+.)-顺式-1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-环庚醇、2-(1-叔丁基)-1-(2-氯苯基)-3-(1,2,4-三唑-1-基)-丙-2-醇、2',6'-二溴-2-甲基-4-三氟甲氧基-4'-三氟甲基-1,3-噻唑-5-甲酰苯胺、1-咪唑基-1-(4'-氯苯氧基)-3,3-二甲基丁-2-酮、(E)-2-[2-[6-(2-氰基苯氧基)嘧啶-4-基氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[6-(2-硫代酰胺基苯氧基)嘧啶-4-基氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[6-(2-氟苯氧基)嘧啶-4-基氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[6-(2,6-二氟苯氧基)嘧啶-4-基氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[3-(嘧啶-2-基氧基)苯氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[3-(5-甲基嘧啶-2-基氧基)-苯氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[3-(苯基-磺酰基氧基)苯氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[3-(4-硝基苯氧基)苯氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-苯氧基苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(3,5-二甲基-苯甲酰基)吡咯-1-基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(3-甲氧基苯氧基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2[2-(2-苯基乙烯-1-基)-苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(3,5-二氯苯氧基)吡啶-3-基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-(2-(3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯氧基)苯基)-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-(2-[3-( $\alpha$ -羟基苄基)苯氧基]苯基)-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-(2-(4-苯氧基吡啶-2-基氧基)苯基)-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(3-正丙氧基-苯氧基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(3-异丙氧基苯氧基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[3-(2-氟苯氧基)苯氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(3-乙氧基苯氧基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(4-叔丁基-吡啶-2-基氧基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[3-(3-氰基苯氧基)苯氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[3-(3-甲基-吡啶-2-基氧基甲基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[6-(2-甲基-苯氧基)嘧啶-4-基氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(5-溴-吡啶-2-基氧基甲基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(3-(3-碘吡啶-2-基氧基)苯氧基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[6-(2-氯吡啶-3-基氧基)嘧啶-4-基氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(5,6-二甲基吡嗪-2-基甲基肟基甲基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-{2-[6-(6-甲基吡啶-2-基氧基)嘧啶-4-基氧基]苯基}-3-甲氧基-丙烯酸甲酯、(E)-2-{2-(3-甲氧基苄基)甲基肟基甲基}-苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-{2-(6-(2-叠氮基苯氧基)-嘧啶-4-基氧基]苯基}-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-{2-[6-苯基嘧啶-4-基]-甲基肟基甲基}苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-{2-[4-氯苯基]-甲基肟基甲基}-苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-{2-[6-(2-正丙基苯氧基)-1,3,5-三嗪-4-基氧基]苯基}-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-{2-[3-(硝基苄基)甲基肟基甲基]苯基}-3-甲氧基丙烯酸甲酯、3-氯-7-(2-氮杂-2,7,7-三甲基-辛-3-烯-5-炔)、2,6-二氯-N-(4-三氟甲基苄基)-苯甲酰胺、3-碘-2-丙炔醇、4-氯苯基-3-碘炔丙基缩甲醛、3-溴-2,3-二碘-2-丙烯基乙基氨基甲酸酯、2,3,3-三碘烯丙醇、3-溴-2,3-二碘-2-丙烯醇、3-碘-2-丙炔基正丁基氨基甲酸酯、3-碘-2-丙炔基正

己基氨基甲酸酯、3-碘-2-丙炔基环己基氨基甲酸酯、3-碘-2-丙炔基苯基氨基甲酸酯；苯酚衍生物，如三溴苯酚、四氯酚、3-甲基-4-氯酚、3,5-二甲基-4-氯酚、苯氧乙醇、二氯酚、邻苯基苯酚、间苯基苯酚、对苯基苯酚、2-苄基-4-氯酚、5-羟基-2(5H)-咪唑酮；4,5-二氯二噻唑啉酮、4,5-苯并二噻唑啉酮、4,5-三亚甲基二噻唑啉酮、4,5-二氯-(3H)-1,2-二硫基-3-酮、3,5-二甲基-四氢-1,3,5-噻二嗪-2-硫酮、N-(2-对氯苯甲酰乙基)-氯化六甲撑四胺、活化酯、八九十混酸(acypetacs)、棉铃威、阿苯达唑、杀螟丹(aldimorph)、蒜素、烯丙醇、辛唑啉菌胺、吡唑磺菌胺、阿姆巴(amobam)、氨丙膦酸(am丙基fos)、敌菌灵、福美砷(asomate)、金色制霉菌素(aureofungin)、阿扎康唑、阿扎芬定(azafendin)、氧化福美双杀菌剂(azithiram)、噻菌酯、钼多硫化物、苯霜灵、苯霜灵-M、麦锈灵(benodanil)、苯菌灵、敌菌脲、丙唑草隆(bentaluron)、苯噻菌胺、苯噻硫氰、氯化苄烷铵、节烯酸(benzamacril)、苯杂吗(benzamorf)、苯甲羟肟酸、苯并烯氟菌唑(benzovindiflupyr)、黄连素、百杀辛(bethoxazin)、双苯三唑醇(biloxazol)、乐杀螨、联苯基、联苯三唑醇、硫双二氯酚、联苯吡菌胺(bixafen)、杀稻瘟菌素-S、啶酰菌胺、溴菌腈、糠菌唑、乙嘧酚磺酸酯、丁硫啉、丁胺多硫化钙、敌菌丹、克菌丹、吗菌威、多菌灵、多菌灵盐酸盐、萎锈灵、加普胺、香芹酮、CGA41396、CGA41397、灭螨猛、壳聚糖、灭痕唑(chlobenthiazole)、双胺灵、氯醌、氯芬唑、地茂散、氯化苦、百菌清、克氯得(chlorozolinate)、乙菌利、氯咪巴唑、克霉唑、克拉康(clozylacon)、含铜的化合物如乙酸铜、碳酸铜、氢氧化铜、环烷酸铜、油酸铜、氯化铜、氧基喹啉铜、硅酸铜、硫酸铜、树脂酸铜、铬酸铜锌和波尔多混合物、甲酚、硫杂灵、福美铜氯(cuprobam)、亚铜的氧化物、氰霜唑、环菌胺(cyclafuramid)、放线菌酮、环氟菌胺、霜脲氰、氰菌灵(cypendazole)、环唑醇、噻菌环胺、棉隆、咪菌威、癸磷锡、脱氢乙酸、二-2-吡啶基二硫化物1,1'-二氧化物、抑菌灵(dichlofluanid)、啉菌清、二氯萘醌、氯硝胺、双氯酚、菌核利、苄氯三唑醇、双氯氰菌胺、乙霉威、苯醚甲环唑、野燕枯、二氟林、0,0-二异-丙基-S-苄基硫代磷酸盐、地美福唑(dimelfluzole)、菌核净、地美康唑(dimetconazole)、烯酰吗啉、二甲嘧酚、烯唑醇、烯唑醇-M、敌螨通、敌螨普、邻敌螨消、硝戊酯(dinopenton)、硝辛酯(dinosulfon)、硝丁酯(dinoterbon)、二苯胺、双吡硫翁、戒酒硫、灭菌磷(ditalimfos)、二噻农、二硫基醚、十二烷基二甲基氯化铵、十二环吗啉、多地辛、多果定、十二烷基胍醋酸盐、敌菌酮、敌瘟磷、烯肟菌酯、氟环唑、乙环唑、代森硫(etem)、噻唑菌胺、乙嘧酚、乙氧喹、乙蒜素(ethilicin)、(Z)-N-苄基-N([甲基(甲基-硫代亚乙基氨基-氧基羰基)氨基]硫基)-β-氨基丙酸乙酯、土菌灵、噁唑菌酮、咪唑菌酮、地克松、咪菌腈、氯苯嘧啶醇、腈苯唑、甲咪酰胺、环酰菌胺、种衣酯、氰菌胺、拌种咯、苯吡克咪德、苯锈啉、丁苯吗啉、胺苯吡菌酮、三苯锡醋酸盐、三苯基氢氧化锡、福美铁、噻菌脲、氟啉胺、咯菌腈、氟美托、氟吗啉、氟吡菌胺(flupicolide)、氟吡菌酰胺、唑咪草、三氟苯唑(flutrimazole)、氟噻菌酯、氟喹唑、氟硅唑、磺菌胺、氟酰胺(flutaniil)、氟酰胺、粉唑醇、氟唑菌酰胺、灭菌丹、甲醛、三乙膦酸、麦穗宁、咪霜灵、福拉比、二甲咪酰胺、咪菌唑、糠醛、茂谷乐、咪菌隆、果绿定、灰黄霉素、双胍辛胺、丙烯酸喹啉酯(halacrinat)、六氯苯、六氯丁二烯、六氯酚、己唑醇、环己硫磷(hexylthiofos)、汞加芬(hydrargaphen)、羟基异噁唑、噁霉灵、抑霉唑、抑霉唑硫酸盐、亚胺唑、双胍辛胺、双胍辛胺三乙酸酯、枯瘟净(inezin)、碘代丙炔基丁基甲胺酸酯(iodocarb)、种菌唑、ipfentrifluconazole、异稻瘟净、异菌脲、丙森锌、异丙基丁基氨基甲酸酯、稻瘟灵、吡唑萘菌胺、异噻菌胺、氯苯咪菌酮(isovaledione)、浸种磷(izopamfos)、春

雷霉素、醚菌酯-甲基、LY186054、LY211795、LY248908、代森锰锌、双炔酰菌胺、代森锰、邻酰胺、咪卡病西(mecarbinzid)、精甲霜灵、氯氟醚菌唑、啞菌胺、灭锈胺、氯化汞、氯化亚汞、消螨多(meptyldinocap)、甲霜灵、精甲霜灵-M、威百亩、胂叉噁唑酮(metazoxolon)、叶菌唑、磺菌威、呋菌胺、甲基溴、甲基碘、异硫氰酸甲酯、代森联、代森联-锌、苯氧菌胺、苯菌酮、噻菌胺、代森环(milneb)、吗啉胍(moroxydine)、腈菌唑、甲菌利(myclozolin)、代森钠(nabam)、那他霉素、田安、福美镍、硝基苯乙烯、醚菌酯、氟苯嘧啶醇、异噁菌酮、呋酰胺、有机汞化合物类、肟醚菌胺、蛇床子素(osthol)、噁霜灵、环氧嘧磺隆、奥辛-铜(oxine-copper)、噁啉酸、欧伯克唑(oxpoconazole)、氧化萎锈灵、苯吡醇(parinol)、稻瘟酯、戊菌唑、戊菌隆、戊苯吡菌胺、五氯酚、吡噻菌胺、氰烯菌酯、叶枯净、氯瘟磷(phosdiphen)、疫霉灵-A1、磷酸类、苯酞、啞氧菌酯、粉病灵、多氨基甲酸酯、多氧菌素D、多氧瑞莫(polyoxrim)、代森联(polyram)、烯丙苯噻唑、咪鲜胺、腐霉利、普罗帕脒(propamidine)、霜霉威、丙环唑、丙森锌、丙酸、丙氧喹啉、硫菌威(prothiocarb)、丙硫菌唑、氟唑菌酰羟胺(pydiflumetofen)、比锈灵、唑菌胺酯、唑胺菌酯(pyrametrostrobin)、唑菌酯、定菌磷、吡菌苯威、啞菌腈(pyridinitril)、啞斑肟、啞霉胺、吡奥芬酮(pyriofenone)、咯啉酮、吡氯灵(pyroxychlor)、氯吡呋醚、吡咯尼林、季铵化合物、羟基喹啉基乙酮(quinacetol)、醌菌胺(quinazamid)、啞啉菌酮(quinconazole)、灭螨猛、啞氧灵、五氯硝基苯、吡啉唑(rabenzazole)、蛔蒿素(santonin)、环苯吡菌胺(sedaxane)、硅噻菌胺、硅氟唑、西克唑(sipconazole)、五氯酚钠、螺环菌胺、链霉素、硫、戊苯砒(sultropen)、戊唑醇、异丁乙氧喹啉(tebfloquin)、叶枯酞、四氯硝基苯、福代硫、氟醚唑、噻苯达唑、噻二氟(thiadifluor)、噻菌腈(thicyofen)、噻氟菌胺、2-(硫氰基甲硫基)苯并噻唑、硫菌灵-甲基、克杀螨(thioquinox)、塞仑、噻啉菌胺、亚胺唑(timibenconazole)、硫氰苯甲酰胺(tioxyimid)、立枯磷-甲基、对甲抑菌灵、三唑酮、三唑醇、威菌磷(triamiphos)、啞菌醇(triarimol)、丁三唑、咪唑啉、三环唑、十三吗啉、肟菌酯、啞虫咪(triflumazole)、啞氨灵、氟菌唑、灭菌唑、烯效唑、福美甲肟(urbacide)、井冈霉素、霜霉灭(valifenalate)、威百、乙烯菌核利、氰菌胺(zarilamid)、代森锌、福美锌、和苯酞菌胺。

[0324] 本发明的化合物也可以与驱蠕虫药剂组合使用。这样的驱蠕虫药剂包括选自大环内酯类化合物的化合物,如伊维菌素、阿维菌素、阿巴美丁、依马克丁、依立诺克丁、多拉克汀、司拉克丁、莫昔克丁、奈马克丁以及米尔倍霉素衍生物,如在EP-357460、EP-444964以及EP-594291中所述。另外的驱蠕虫药剂包括半合成及生物合成阿维菌素/米尔倍霉素衍生物,如在US-5015630、W0-9415944以及W0-9522552中所述的那些。另外的驱蠕虫药剂包括苯并咪唑类,如阿苯达唑、坎苯达唑、芬苯达唑、氟苯达唑、甲苯达唑、奥芬达唑、奥苯达唑、帕苯达唑、以及该类别的其他成员。另外的驱蠕虫药剂包括咪唑并噻唑类以及四氢嘧啶类,如四咪唑、左旋咪唑、双羟萘酸噻嘧啶、奥克太尔或莫仑太尔。另外的驱蠕虫药剂包括杀吸虫剂(如三氯苯达唑和氯舒隆)以及杀绦虫剂(如吡啉酮和依西太尔)。

[0325] 本发明的化合物可以与对郝青酰胺(paraherquamide)/马可氟汀(marcfortine)类驱蠕虫药剂的衍生物及类似物以及抗寄生虫噁唑啉(如在US-5478855、US-4639771和DE-19520936中所披露的)组合使用。

[0326] 本发明的化合物可以与如W0 96/15121中所述的一般种类二氧代吗啉抗寄生虫剂的衍生物及类似物以及还与驱蠕虫活性的环状缩酚肽(如W0 96/11945、W0 93/19053、W0

93/25543、EP 0 626 375、EP 0 382 173、WO 94/19334、EP 0 382 173和EP 0 503 538中所述的那些)组合使用。

[0327] 本发明的化合物可以与其他杀体外寄生虫药组合使用;例如,氟虫腈;拟除虫菊酯;有机磷酸酯;昆虫生长调节剂如氯芬奴隆;蜕皮激素激动剂如虫酰肼等;新烟碱类如吡虫啉等。

[0328] 本发明的化合物可以与萜烯生物碱类组合使用,例如国际专利申请公开号W0 95/19363或W0 04/72086中所述的那些,特别是其中所披露的化合物。

[0329] 可以与本发明的化合物组合使用的这样的生物活性化合物的其他实例包括但不限于以下项:

[0330] 有机磷酸酯:乙酰甲胺磷、甲基吡啶磷、乙基谷硫磷、甲基谷硫磷、溴硫磷、乙基溴硫磷、硫线磷、四氯乙磷(chlorethoxyphos)、毒死蜱、氯芬磷、氯甲磷、内吸磷、内吸磷-S-甲基、内吸磷-S-甲基砒、氯亚胺硫磷、二嗪磷、敌敌畏、百治磷、乐果、乙拌磷、乙硫磷、灭线磷、氧嘧啶磷、伐灭磷、苯线磷、杀螟硫磷、丰索磷、倍硫磷、吡氟硫磷、地虫磷、安果、噻唑磷、庚烯磷、氯唑磷、异丙磷、异噻唑磷、马拉硫磷、虫螨畏、甲胺磷、杀扑磷、甲基对硫磷、速灭磷、久效磷、二溴磷、氧乐果、甲基氧代内吸磷、对氧磷、对硫磷、甲基对硫磷、稻丰散、伏杀硫磷、硫环磷、磷克、亚胺硫磷、磷胺、甲拌磷、肟硫磷、虫螨磷、虫螨磷-甲基、丙溴磷、丙虫磷、proetamphos、丙硫磷、吡唑硫磷、哒嗪硫磷、啉硫磷、硫灭克磷、替美磷、特丁磷、丁基嘧啶磷、司替罗磷、二甲硫吸磷(thimeton)、三唑磷、敌百虫、灭蚜硫磷。

[0331] 氨基甲酸酯:棉铃威、涕灭威、2-仲丁苯基甲基氨基甲酸酯、丙硫克百威、甲萘威、克百威、丁硫克百威、地虫威、乙硫苯威、苯氧威、芬硫克、呋线威、HCN-801、异丙威、茚虫威、灭虫威、灭多虫、5-甲基-间-异丙苯基丁炔基(甲基)氨基甲酸酯、杀线威、抗蚜威、残杀威、硫双威、久效威、啉蚜威、UC-51717。

[0332] 拟除虫菊酯:氟丙菊酯、烯丙菊酯、 $\alpha$ -氯氰菊酯(alphamethrin)、(E)-(1R)-顺式-2,2-二甲基-3-(2-氧硫杂环戊-3-亚基甲基)环丙烷甲酸5-苄基-3-呋喃基甲酯、联苯菊酯、 $\beta$ -氟氯氰菊酯、氟氯氰菊酯、 $\alpha$ -氯氰菊酯( $\alpha$ -cypermethrin)、 $\beta$ -氯氰菊酯、生物烯丙菊酯、生物烯丙菊酯((S)-环戊基异构体)、生物苄呋菊酯、联苯菊酯、NCI-85193、乙氰菊酯、氯氟氰菊酯、塞西塞林(cythothrin)、苯醚氰菊酯、溴氰菊酯、炔戊菊酯、高氰戊菊酯、醚菊酯、五氟苯菊酯、甲氰菊酯、氰戊菊酯、氟氰菊酯、氟氯苯菊酯、氟胺氰菊酯(D异构体)、炔咪菊酯、氯氟氰菊酯、 $\lambda$ -氯氟氰菊酯、氯菊酯、苯醚菊酯、炔丙菊酯、除虫菊酯(天然产物)、苄呋菊酯、胺菊酯、四氟苯菊酯、 $\theta$ -氯氰菊酯、氟硅菊酯、 $t$ -氟胺氰菊酯、七氟菊酯、四溴菊酯、 $\zeta$ -氯氰菊酯。

[0333] 节肢动物生长调节剂:a)甲壳质合成抑制剂:苯甲酰脲:定虫隆、除虫脲、氟佐隆、氟螨脲、氟虫脲、氟铃脲、虱螨脲、双苯氟脲、伏虫脲、杀虫脲、噻嗪酮、苯虫醚、噻嗪酮、乙螨啉、四螨嗪(chlorfentazine);b)蜕皮激素拮抗剂:氯虫酰肼、甲氧虫酰肼、虫酰肼;c)保幼激素类似物:吡丙醚、烯虫酯(包括S-烯虫酯)、苯氧威;d)脂质生物合成抑制剂:螺螨酯。

[0334] 其他抗寄生虫药:灭螨醌、双甲脒、AKD-1022、ANS-118、印楝素、苏云金杆菌、杀虫磺、联苯肼酯、乐杀螨、溴螨酯、BTG-504、BTG-505、毒杀芬、杀螟丹、敌螨酯、杀虫脒、溴虫腈、环虫酰肼、噻虫胺、赛灭净、敌克隆登(diacloden)、杀螨隆、DBI-3204、二活菌素、二羟基甲基二羟基吡咯烷、敌螨通、敌螨普、硫丹、乙虫腈、醚菊酯、啉螨醚、氟螨啉(flumite)、MTI-800、啉螨酯、啉螨酯、氟螨啉、溴氟菊酯、氟螨啉、三氟醚、苄螨醚(fluproxyfen)、苄螨醚

(halofenprox)、氟蚁腓、IKI-220、水硅钠石、NC-196、印度薄荷草 (neem guard)、尼敌诺特呋喃 (nidinorterfuran)、烯啉虫胺、SD-35651、WL-108477、啉虫丙醚、克螨特、普罗芬布特 (protrifenbute)、吡蚜酮、哒螨酮、啉螨醚、NC-1111、R-195、RH-0345、RH-2485、RYI-210、S-1283、S-1833、SI-8601、氟硅菊酯、硅罗玛汀 (silomadine)、多杀菌素、吡螨胺、三氯杀螨砒、四抗菌素、噻虫啉、杀虫环、噻虫嗪、啉虫酰胺、啉蚜威、三乙多杀菌素、三活菌素、增效炔醚、波塔雷克 (vertalec)、YI-5301。

[0335] 生物剂: 苏云金芽孢杆菌亚莎华亚种 (*Bacillus thuringiensis* ssp *aizawai*)、苏云金芽孢杆菌库斯塔克亚种 (*kurstaki*)、苏云金芽孢杆菌 $\delta$ 内毒素、杆状病毒、昆虫病原细菌、病毒以及真菌。

[0336] 杀细菌剂: 金霉素、土霉素、链霉素。

[0337] 其他生物剂: 恩氟沙星、非班太尔、喷沙西林、美洛昔康、头孢氨苄、卡那霉素、匹莫苯、克仑特罗、奥美拉唑、硫姆林、贝那普利、皮瑞普 (pyriprole)、头孢喹肟、氟苯尼考、布舍瑞林、头孢维星、托拉菌素、头孢噻吩、卡洛芬、美氟啉、吡啶酮、三氯苯达唑。

[0338] 具有式 (I) 的化合物与活性成分的以下混合物是优选的。缩写“TX”表示选自下组的一种化合物, 该组由以下各项组成: 如表 1.1 至 1.7 和表 2.1 和 2.7 中表示的化合物、或表 T1 (下文) 中列出的化合物 1.1 至 1.112、表 T2 (下文) 中列出的化合物 2.1 至 2.39、表 T3 (下文) 中列出的化合物 3.1 至 3.36、或表 T4 (下文) 中列出的化合物 4.1 至 4.2 列出的化合物。

[0339] 佐剂, 该佐剂选自由以下组成的物质组: 石油 (别名) (628) + TX,

[0340] 杀螨剂, 该杀螨剂选自由以下组成的物质组: 1,1-双(4-氯苯基)-2-乙氧基乙醇 (IUPAC 名称) (910) + TX、2,4-二氯苯基苯磺酸盐 (IUPAC/化学文摘名称) (1059) + TX、2-氟-N-甲基-N-1-萘基乙酰胺 (IUPAC 名称) (1295) + TX、4-氯苯基苯基砒 (IUPAC 名称) (981) + TX、阿维菌素 (1) + TX、灭螨醌 (3) + TX、乙酰虫脲 [CCN] + TX、氟丙菊酯 (9) + TX、涕灭威 (16) + TX、涕灭砒威 (863) + TX、 $\alpha$ -氯氰菊酯 (202) + TX、赛果 (870) + TX、磺胺螨酯 [CCN] + TX、果满磷 (872) + TX、胺吸磷 (875) + TX、胺吸磷草酸氢盐 (875) + TX、双甲脒 (24) + TX、杀螨特 (881) + TX、三氧化二砷 (882) + TX、AVI 382 (化合物代码) + TX、AZ 60541 (化合物代码) + TX、乙基谷硫磷 (44) + TX、甲基谷硫磷 (45) + TX、偶氮苯 (IUPAC 名称) (888) + TX、三唑锡 (46) + TX、偶氮磷 (889) + TX、苯菌灵 (62) + TX、苯噁磷 (别名) [CCN] + TX、苯螨特 (71) + TX、苯甲酸苄酯 (IUPAC 名称) [CCN] + TX、联苯肼酯 (74) + TX、联苯菊酯 (76) + TX、乐杀螨 (907) + TX、溴灭菊酯 (别名) + TX、溴烯杀 (918) + TX、溴硫磷 (920) + TX、乙基溴硫磷 (921) + TX、溴螨酯 (94) + TX、稻虱净 (99) + TX、丁酮威 (103) + TX、丁酮砒威 (104) + TX、丁基哒螨灵 (别名) + TX、多硫化钙 (IUPAC 名称) (111) + TX、毒杀芬 (941) + TX、氯灭杀威 (943) + TX、西维因 (115) + TX、卡巴呋喃 (118) + TX、三硫磷 (947) + TX、CGA 50' 439 (开发代码) (125) + TX、灭螨猛 (126) + TX、氯杀螨 (959) + TX、杀虫脒 (964) + TX、杀虫脒盐酸盐 (964) + TX、溴虫脲 (130) + TX、杀螨醇 (968) + TX、杀螨酯 (970) + TX、敌螨丹 (971) + TX、毒虫畏 (131) + TX、克氯苯 (975) + TX、灭螨咪 (977) + TX、灭虫脲 (978) + TX、丙酯杀螨醇 (983) + TX、毒死蜱 (145) + TX、甲基毒死蜱 (146) + TX、虫螨磷 (994) + TX、瓜菊酯 I (696) + TX、瓜菊酯 II (696) + TX、瓜菊酯 (696) + TX、四螨嗪 (158) + TX、氯氰碘柳胺 (别名) [CCN] + TX、蝇毒磷 (174) + TX、克罗米通 (别名) [CCN] + TX、丁烯磷 (1010) + TX、硫杂灵 (1013) + TX、果虫磷 (1020) + TX、丁氟螨酯 (CAS 登记号: 400882-07-7) + TX、三氟氯氰菊酯 (196) + TX、三环锡 (199) + TX、氯氰菊酯 (201) + TX、DCPM (1032) + TX、DDT (219) + TX、田乐磷 (1037) + TX、田乐磷-O (1037) + TX、田乐磷-S (1037)

+TX、内吸磷(1038)+TX、内吸磷甲基(224)+TX、内吸磷-0(1038)+TX、内吸磷-0-甲基(224)+TX、内吸磷-S(1038)+TX、内吸磷-S-甲基(224)+TX、内吸磷-S-甲基砒(1039)+TX、丁醚脲(226)+TX、氯亚胺硫磷(1042)+TX、二嗪农(227)+TX、抑菌灵(230)+TX、敌敌畏(236)+TX、二克磷(dicliphos)(别名)+TX、开乐散(242)+TX、百治磷(243)+TX、除螨灵(1071)+TX、甲氟磷(1081)+TX、乐果(262)+TX、二活菌素(别名)(653)+TX、消螨酚(1089)+TX、消螨酚(dinex-diclexine)(1089)+TX、消螨通(269)+TX、敌螨普(270)+TX、敌螨普-4[CCN]+TX、敌螨普-6[CCN]+TX、邻敌螨消(1090)+TX、硝戊酯(1092)+TX、硝辛酯(1097)+TX、硝丁酯(1098)+TX、敌杀磷(1102)+TX、二苯砒(IUPAC名称)(1103)+TX、戒酒硫(别名)[CCN]+TX、乙拌磷(278)+TX、DNOC(282)+TX、苯氧炔螨(1113)+TX、多拉菌素(别名)[CCN]+TX、硫丹(294)+TX、因毒磷(1121)+TX、EPN(297)+TX、依立诺克丁(别名)[CCN]+TX、乙硫磷(309)+TX、益果(1134)+TX、乙螨唑(320)+TX、乙噻硫磷(1142)+TX、抗螨唑(1147)+TX、啞螨醚(328)+TX、苯丁锡(330)+TX、苯硫威(337)+TX、甲氰菊酯(342)+TX、吡螨胺(别名)+TX、啞螨酯(345)+TX、除螨酯(1157)+TX、芳氟胺(1161)+TX、氰戊菊酯(349)+TX、氟虫腈(354)+TX、啞螨酯(360)+TX、啞蛄脲(1166)+TX、氟螨噻(1167)+TX、氟环脲(366)+TX、氟氰戊菊酯(367)+TX、联氟螨(1169)+TX、氟虫脲(370)+TX、氟氯苯菊酯(372)+TX、氟杀螨(1174)+TX、氟胺氰菊酯(1184)+TX、FMC 1137(开发代码)(1185)+TX、杀螨脒(405)+TX、杀螨脒盐酸盐(405)+TX、安果(1192)+TX、胺甲威(1193)+TX、 $\gamma$ -HCH(430)+TX、果绿定(1205)+TX、苜蓿醚(424)+TX、庚烯磷(432)+TX、十六烷基环丙烷甲酸酯(IUPAC/化学文摘名称)(1216)+TX、噻螨酮(441)+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、水胺硫磷(别名)(473)+TX、异丙基0-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸盐(IUPAC名称)(473)+TX、伊佛霉素(别名)[CCN]+TX、茉莉菊酯I(696)+TX、茉莉菊酯II(696)+TX、碘硫磷(1248)+TX、灵丹(430)+TX、氯芬奴隆(490)+TX、马拉硫磷(492)+TX、丙螨氰(1254)+TX、灭蚜磷(502)+TX、地胺磷(1261)+TX、甲硫芬(别名)[CCN]+TX、虫螨畏(1266)+TX、甲胺磷(527)+TX、杀扑磷(529)+TX、灭虫威(530)+TX、灭多虫(531)+TX、甲基溴(537)+TX、速灭威(550)+TX、速灭磷(556)+TX、兹克威(1290)+TX、密灭汀(557)+TX、米尔贝肟(别名)[CCN]+TX、丙胺氟(1293)+TX、久效磷(561)+TX、茂果(1300)+TX、莫昔克丁(别名)[CCN]+TX、二溴磷(567)+TX、NC-184(化合物代码)+TX、NC-512(化合物代码)+TX、氟蚁灵(1309)+TX、日光霉素(nikkomycins)(别名)[CCN]+TX、戊氰威(1313)+TX、戊氰威1:1氯化锌络合物(1313)+TX、NNI-0101(化合物代码)+TX、NNI-0250(化合物代码)+TX、氧化乐果(594)+TX、草氨酰(602)+TX、异亚砒磷(1324)+TX、砒拌磷(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、对硫磷(615)+TX、苜蓿菊酯(626)+TX、石油(别名)(628)+TX、芬硫磷(1330)+TX、稻丰散(631)+TX、甲拌磷(636)+TX、伏杀磷(637)+TX、硫环磷(1338)+TX、亚胺硫磷(638)+TX、磷胺(639)+TX、辛硫磷(642)+TX、甲基噻啉磷(652)+TX、聚氯萘烯(传统名称)(1347)+TX、浏阳霉素(别名)(653)+TX、丙氯醇(1350)+TX、丙溴磷(662)+TX、蛄虱威(1354)+TX、克螨特(671)+TX、巴胺磷(673)+TX、残杀威(678)+TX、乙噻唑磷(1360)+TX、发硫磷(1362)+TX、除虫菊酯I(696)+TX、除虫菊酯II(696)+TX、除虫菊酯(696)+TX、啞螨灵(699)+TX、啞噻硫磷(701)+TX、啞螨醚(706)+TX、啞硫磷(1370)+TX、啞硫磷(quinalphos)(711)+TX、啞硫磷(quintiofos)(1381)+TX、R-1492(开发代码)(1382)+TX、RA-17(开发代码)(1383)+TX、鱼藤酮(722)+TX、八甲磷(1389)+TX、克线丹(别名)+TX、司拉克丁(别名)[CCN]+TX、SI-0009(化合物代码)+TX、苏硫磷(1402)+TX、螺螨酯(738)+TX、螺甲螨酯(739)+TX、SSI-121(开发代码)(1404)+TX、舒非仑(别名)

[CCN]+TX、氟虫胺(750)+TX、治螟磷(753)+TX、硫磺(754)+TX、SZI-121(开发代码)(757)+TX、 $\tau$ -氟胺氰菊酯(398)+TX、吡螨胺(763)+TX、TEPP(1417)+TX、叔丁威(别名)+TX、杀虫畏(777)+TX、四氯杀螨砜(786)+TX、杀螨素(别名)(653)+TX、杀螨好(1425)+TX、噻芬诺(别名)+TX、抗虫威(1431)+TX、久效威(800)+TX、甲基乙拌磷(801)+TX、克杀螨(1436)+TX、苏云金素(别名)[CCN]+TX、威菌磷(1441)+TX、苯螨噻(1443)+TX、三唑磷(820)+TX、啞蚜威(triazuron)(别名)+TX、敌百虫(824)+TX、三氯丙氧磷(1455)+TX、三活菌素(别名)(653)+TX、蚜灭多(847)+TX、氟吡啶虫(vaniliprole)[CCN]和YI-5302(化合物代码)+TX、

[0341] 杀藻剂,该杀藻剂选自由以下组成的物质组:百杀辛(bethoxazin)[CCN]+TX、二辛酸铜(IUPAC名称)(170)+TX、硫酸铜(172)+TX、cybutryne[CCN]+TX、二氢萘醌(dichlone)(1052)+TX、双氯酚(232)+TX、茵多酸(295)+TX、三苯锡(fentin)(347)+TX、熟石灰[CCN]+TX、代森钠(nabam)(566)+TX、灭藻醌(quinoclamine)(714)+TX、醌萘胺(quinonamid)(1379)+TX、西玛津(730)+TX、三苯锡乙酸盐(IUPAC名称)(347)和氢氧化三苯锡(IUPAC名称)(347)+TX、

[0342] 驱蠕虫剂,该驱蠕虫剂选自由以下组成的物质组:阿巴美丁(1)+TX、克芦磷酯(1011)+TX、多拉克汀(别名)[CCN]+TX、依马克丁(291)+TX、依马克丁苯甲酸酯(291)+TX、依立诺克丁(别名)[CCN]+TX、伊维菌素(别名)[CCN]+TX、米尔倍霉素(别名)[CCN]+TX、莫昔克丁(别名)[CCN]+TX、哌嗪[CCN]+TX、塞拉菌素(selamectin)(别名)[CCN]+TX、多杀菌素(737)和硫菌灵(thiophanate)(1435)+TX、

[0343] 杀鸟剂,该杀鸟剂选自由以下组成的物质组:氯醛糖(127)+TX、异狄氏剂(1122)+TX、倍硫磷(346)+TX、吡啶-4-胺(IUPAC名称)(23)和士的宁(745)+TX、

[0344] 杀细菌剂,该杀细菌剂选自由以下组成的物质组:1-羟基-1H-吡啶-2-硫酮(IUPAC名称)(1222)+TX、4-(喹啉啉-2-基氨基)苯磺酰胺(IUPAC名称)(748)+TX、8-羟基喹啉硫酸盐(446)+TX、溴硝醇(97)+TX、二辛酸铜(IUPAC名称)(170)+TX、氢氧化铜(IUPAC名称)(169)+TX、甲酚[CCN]+TX、双氯酚(232)+TX、双吡硫翁(1105)+TX、多地辛(1112)+TX、敌磺钠(fenamino-sulf)(1144)+TX、甲醛(404)+TX、汞加芬(别名)[CCN]+TX、春雷霉素(483)+TX、春雷霉素盐酸盐水合物(483)+TX、二(二甲基二硫代氨基甲酸盐)镍(IUPAC名称)(1308)+TX、三氯甲基吡啶(nitrapyrin)(580)+TX、辛噻酮(octhilinone)(590)+TX、奥索利酸(606)+TX、土霉素(611)+TX、羟基喹啉硫酸钾(446)+TX、烯丙苯噻唑(probenazole)(658)+TX、链霉素(744)+TX、链霉素倍半硫酸盐(744)+TX、叶枯酞(766)+TX、和硫柳汞(别名)[CCN]+TX、

[0345] 生物试剂,该生物试剂选自由以下组成的物质组:棉褐带卷蛾颗粒体病毒(Adoxophyes orana GV)(12)+TX、放射形土壤杆菌(Agrobacterium radiobacter)(别名)(13)+TX、捕食螨(Amblyseius spp.)(别名)(19)+TX、芥菜夜蛾核多角体病毒(Anagrapha falcifera NPV)(别名)(28)+TX、原缨翅小蜂(Anagrus atomus)(别名)(29)+TX、短距虫牙小蜂(Aphelinus abdominalis)(别名)(33)+TX、棉虫牙寄生蜂(Aphidius colemani)(别名)(34)+TX、食蚜瘦蚊(Aphidoletes aphidimyza)(别名)(35)+TX、苜蓿银纹夜蛾核多角体病毒(Autographa californica NPV)(别名)(38)+TX、坚硬芽孢杆菌(Bacillus firmus)(别名)(48)+TX、球形芽孢杆菌(Bacillus sphaericus Neide)(学名)(49)+TX、苏云金芽孢杆菌(Bacillus thuringiensis Berliner)(学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌鲑泽亚种(Bacillus thuringiensis subsp.aizawai)(学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌以色列亚种

(*Bacillus thuringiensis* subsp.*israelensis*) (学名) (51)+TX、苏云金芽孢杆菌日本亚种(*Bacillus thuringiensis* subsp.*japonensis*) (学名) (51)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(*Bacillus thuringiensis* subsp.*kurstaki*) (学名) (51)+TX、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种(*Bacillus thuringiensis* subsp.*tenebrionis*) (学名) (51)+TX、球孢白僵菌(*Beauveria bassiana*) (别名) (53)+TX、布氏白僵菌(*Beauveria brongniartii*) (别名) (54)+TX、普通草蛉(*Chrysoperla carnea*) (别名) (151)+TX、孟氏隐唇票瓜虫(*Cryptolaemus montrouzieri*) (178)+TX、苹果蠹蛾颗粒体病毒(*Cydia pomonella* GV) (别名) (191)+TX、西伯利亚离颚茧蜂(*Dacnusa sibirica*) (别名) (212)+TX、碗豆潜叶绳姬小蜂(*Diglyphus isaea*) (别名) (254)+TX、丽蚜小蜂(*Encarsia formosa*) (学名) (293)+TX、奖角蚜小蜂(*Eretmocerus eremicus*) (别名) (300)+TX、玉米穆夜蛾核多角体病毒(*Helicoverpa zea* NPV) (431)+TX、嗜菌异小杆线虫(*Heterorhabditis bacteriophora*) 和大异小杆线虫(*H.megidis*) (别名) (433)+TX、会聚长足瓢虫(*Hippodamia convergens*) (别名) (442)+TX、橘粉介壳虫寄生蜂(*Leptomastix dactylopii*) (别名) (488)+TX、盲畴(*Macrolophus caliginosus*) (别名) (491)+TX、甘蓝夜蛾核多角体病毒(*Mamestra brassicae* NPV) (494)+TX、黄阔柄跳小蜂(*Metaphycus helvolus*) (别名) (522)+TX、金龟子绿僵菌蝗变种(*Metarhizium anisopliae* var.*acridum*) (学名) (523)+TX、金龟子绿僵菌小孢变种(*Metarhizium anisopliae* var.*anisopliae*) (学名) (523)+TX、松黄叶蜂核多角体病毒(*Neodiprion sertifer* NPV) 和红头松树叶蜂核多角体病毒(*N.lecontei* NPV) (别名) (575)+TX、小花畴(*Orius* spp.) (别名) (596)+TX、玫烟色拟青霉(*Paecilomyces fumosoroseus*) (别名) (613)+TX、智利捕植螨(*Phytoseiulus persimilis*) (别名) (644)+TX、甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua*) 多核衣壳核多角体病毒(学名) (741)+TX、毛蚊线虫(*Steinernema bibionis*) (别名) (742)+TX、小卷蛾斯氏线虫(*Steinernema carpocapsae*) (别名) (742)+TX、夜蛾斯氏线虫(*Steinernema feltiae*) (别名) (742)+TX、格氏斯氏线虫(*Steinernema glaseri*) (别名) (742)+TX、*Steinernema riobrave* (别名) (742)+TX、*Steinernema riobrave* (别名) (742)+TX、*Steinernema scapterisci* (别名) (742)+TX、斯万氏线虫属(*Steinernema* spp.) (别名) (742)+TX、赤眼蜂属(*Trichogramma* spp.) (别名) (826)+TX、西方盲走螨(*Typhlodromus occidentalis*) (别名) (844) 和蜡蚧轮枝菌(*Verticillium lecanii*) (848)+TX、解淀粉枯草芽孢杆菌变种(*Bacillus subtilis* var.*amyloliquefaciens*) 菌株FZB24(可得自美国弗吉尼亚州塞勒姆5400企业园区的诺维信生物公司(Novozymes Biologicals Inc., 5400Corporate Circle, Salem, VA 24153, U.S.A.) 并以商品名**Taegro®**广为人知)+TX,

[0346] 土壤消毒剂, 该土壤消毒剂选自由以下组成的物质组: 碘甲烷(IUPAC名称) (542) 和溴甲烷(537)+TX,

[0347] 化学不育剂, 该化学不育剂选自由以下组成的物质组: 啞磷嗪(apholate) [CCN]+TX、双(氮丙啶)甲氨基膦硫化物(bisazir) (别名) [CCN]+TX、白消安(别名) [CCN]+TX、除虫脲(250)+TX、迪麦替夫(dimatif) (别名) [CCN]+TX、六甲蜜胺(hemel) [CCN]+TX、六甲磷(hempa) [CCN]+TX、甲基涕巴(metepa) [CCN]+TX、甲硫涕巴(methiotepa) [CCN]+TX、不育特(methyl apholate) [CCN]+TX、不孕啶(morzid) [CCN]+TX、氟幼脲(penfluron) (别名) [CCN]+TX、涕巴(tepa) [CCN]+TX、硫代六甲磷(thiohempa) (别名) [CCN]+TX、硫涕巴(别名) [CCN]+



TX、曲他胺(别名)[CCN]和尿烷亚胺(别名)[CCN]+TX,

[0348] 昆虫信息素,该昆虫信息素选自由以下组成的物质组:(E)-癸-5-烯-1-基乙酸酯与(E)-癸-5-烯-1-醇(IUPAC名称)(222)+TX、(E)-十三碳-4-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(829)+TX、(E)-6-甲基庚-2-烯-4-醇(IUPAC名称)(541)+TX、(E,Z)-十四碳-4,10-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(779)+TX、(Z)-十二碳-7-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(285)+TX、(Z)-十六碳-11-烯醛(IUPAC名称)(436)+TX、(Z)-十六碳-11-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(437)+TX、(Z)-十六碳-13-烯-11-炔-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(438)+TX、(Z)-二十-13-烯-10-酮(IUPAC名称)(448)+TX、(Z)-十四碳-7-烯-1-醛(IUPAC名称)(782)+TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-醇(IUPAC名称)(783)+TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(784)+TX、(7E,9Z)-十二碳-7,9-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(283)+TX、(9Z,11E)-十四碳-9,11-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(780)+TX、(9Z,12E)-十四碳-9,12-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(781)+TX、14-甲基十八-1-烯(IUPAC名称)(545)+TX、4-甲基壬醛-5-醇与4-甲基壬醛-5-酮(IUPAC名称)(544)+TX、 $\alpha$ -多纹素(multistriatin)(别名)[CCN]+TX、西部松小蠹集合信息素(brevicommin)(别名)[CCN]+TX、十二碳二烯醇(codlure)(别名)[CCN]+TX、可得蒙(codlemone)(别名)(167)+TX、诱蝇酮(cuelure)(别名)(179)+TX、环氧十九烷(disparlure)(277)+TX、十二碳-8-烯-1基乙酸酯(IUPAC名称)(286)+TX、十二碳-9-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(287)+TX、十二碳-8+TX、10-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(284)+TX、dominicalure(别名)[CCN]+TX、4-甲基辛酸乙酯(IUPAC名称)(317)+TX、丁香酚(别名)[CCN]+TX、南部松小蠹集合信息素(frontalin)(别名)[CCN]+TX、诱虫十六酯(gossyplure)(别名)(420)+TX、诱杀烯混剂(grandlure)(421)+TX、诱杀烯混剂I(别名)(421)+TX、诱杀烯混剂II(别名)(421)+TX、诱杀烯混剂III(别名)(421)+TX、诱杀烯混剂IV(别名)(421)+TX、醋酸十六烯酯(hexalure)[CCN]+TX、齿小蠹二烯醇(ipsdienol)(别名)[CCN]+TX、小蠹烯醇(ipsenol)(别名)[CCN]+TX、金龟子性诱剂(japonilure)(别名)(481)+TX、lineatin(别名)[CCN]+TX、litlure(别名)[CCN]+TX、粉纹夜蛾性诱剂(looplure)(别名)[CCN]+TX、诱杀酯(medlure)[CCN]+TX、megatomoic acid(别名)[CCN]+TX、诱虫醚(methyl eugenol)(别名)(540)+TX、诱虫烯(muscalure)(563)+TX、十八-2,13-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(588)+TX、十八-3,13-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(589)+TX、贺康彼(orfralure)(别名)[CCN]+TX、oryctalure(别名)(317)+TX、非乐康(ostramone)(别名)[CCN]+TX、诱虫环(siglure)[CCN]+TX、sordidin(别名)(736)+TX、食菌甲诱醇(sulcatol)(别名)[CCN]+TX、十四-11-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(785)+TX、特诱酮(839)+TX、特诱酮A(别名)(839)+TX、特诱酮B<sub>1</sub>(别名)(839)+TX、特诱酮B<sub>2</sub>(别名)(839)+TX、特诱酮C(别名)(839)和trunc-call(别名)[CCN]+TX,

[0349] 昆虫驱避剂,该昆虫驱避剂选自由以下组成的物质组:2-(辛基硫代)乙醇(IUPAC名称)(591)+TX、避蚊酮(butopyronoxyl)(933)+TX、丁氧基(聚丙二醇)(936)+TX、己二酸二丁酯(IUPAC名称)(1046)+TX、邻苯二甲酸二丁酯(1047)+TX、丁二酸二丁酯(IUPAC名称)(1048)+TX、避蚊胺[CCN]+TX、驱蚊酯(dimethyl carbate)[CCN]+TX、邻苯二甲酸二甲酯[CCN]+TX、乙基己二醇(1137)+TX、己脲[CCN]+TX、甲喹丁(methoquin-butyl)(1276)+TX、甲基新癸酰胺[CCN]+TX、氨基甲酸酯(oxamate)[CCN]和羟哌酯[CCN]+TX,

[0350] 杀昆虫剂,该杀昆虫剂选自由以下组成的物质组:1-二氯-1-硝基乙烷(IUPAC/化

学文摘名) (1058)+TX、1,1-二氯-2,2-双(4-乙基苯基)乙烷(IUPAC名称) (1056)+TX、1,2-二氯丙烷(IUPAC/化学文摘名) (1062)+TX、1,2-二氯丙烷与1,3-二氯丙烯(IUPAC名称) (1063)+TX、1-溴-2-氯乙烷(IUPAC/化学文摘名) (916)+TX、2,2,2-三氯-1-(3,4-二氯苯基)乙基乙酸酯(IUPAC名称) (1451)+TX、2,2-二氯乙烯基2-乙基亚磺酰基乙基甲基磷酸酯(IUPAC名称) (1066)+TX、2-(1,3-二硫杂环戊烷-2-基)苯基二甲基氨基甲酸酯(IUPAC/化学文摘名) (1109)+TX、2-(2-丁氧基乙氧基)乙基硫氰酸酯(IUPAC/化学文摘名) (935)+TX、2-(4,5-二甲基-1,3-二氧戊环-2-基)苯基甲基氨基甲酸酯(IUPAC/化学文摘名) (1084)+TX、2-(4-氯-3,5-二甲苯基氧基)乙醇(IUPAC名称) (986)+TX、2-氯乙烯基二乙基磷酸酯(IUPAC名称) (984)+TX、2-咪唑烷酮(IUPAC名称) (1225)+TX、2-异戊酰基茛满-1,3-二酮(IUPAC名称) (1246)+TX、2-甲基(丙-2-炔基)氨基苯基甲基氨基甲酸酯(IUPAC名称) (1284)+TX、2-硫代氰酰乙基月桂酸酯(IUPAC名称) (1433)+TX、3-溴-1-氯丙-1-烯(IUPAC名称) (917)+TX、3-甲基-1-苯基吡唑-5-基二甲基氨基甲酸酯(IUPAC名称) (1283)+TX、4-甲基(丙-2-炔基)氨基-3,5-二甲苯基甲基氨基甲酸酯(IUPAC名称) (1285)+TX、5,5-二甲基-3-氧代环己-1-烯基二甲基氨基甲酸酯(IUPAC名称) (1085)+TX、阿巴美丁(1)+TX、乙酰甲胺磷(2)+TX、啉虫脒(4)+TX、家蝇磷(别名)[CCN]+TX、乙酰虫脒[CCN]+TX、氟丙菊酯(9)+TX、丙烯腈(IUPAC名称) (861)+TX、棉铃威(15)+TX、涕灭威(16)+TX、涕灭砒威(863)+TX、阿耳德林(864)+TX、丙烯菊酯(17)+TX、阿洛氯菌素(别名)[CCN]+TX、除害威(866)+TX、 $\alpha$ -氯氰菊酯(202)+TX、 $\alpha$ -蜕皮激素(别名)[CCN]+TX、磷化铝(640)+TX、赛果(870)+TX、果满磷(872)+TX、灭害威(873)+TX、胺吸磷(875)+TX、草酸氢胺吸磷(875)+TX、双甲脒(24)+TX、新烟碱(877)+TX、乙基杀扑磷(883)+TX、AVI 382(化合物代码)+TX、AZ 60541(化合物代码)+TX、印楝素(别名)(41)+TX、甲基吡啶磷(42)+TX、益棉磷(44)+TX、甲基谷硫磷(45)+TX、偶氮磷(889)+TX、苏云金芽孢杆菌 $\delta$ -内毒素(别名)(52)+TX、六氟合硅酸钡(别名)[CCN]+TX、多硫化钡(IUPAC/化学文摘名) (892)+TX、熏菊酯[CCN]+TX、拜耳22/190(开发代码) (893)+TX、拜耳22408(开发代码) (894)+TX、恶虫威(58)+TX、丙硫克百威(60)+TX、杀虫磺(66)+TX、 $\beta$ -氟氯氰菊酯(194)+TX、 $\beta$ -氯氰菊酯(203)+TX、联苯菊酯(76)+TX、生物丙烯菊酯(78)+TX、生物丙烯菊酯S-环戊烯基异构体(别名)(79)+TX、生物环吡菊酯(bioethanomethrin)[CCN]+TX、生物氯菊酯(908)+TX、生物苜蓿菊酯(80)+TX、双(2-氯乙基)醚(IUPAC名称) (909)+TX、双三氟虫脒(83)+TX、硼砂(86)+TX、溴灭菊酯(别名)+TX、溴苯烯磷(914)+TX、溴烯杀(918)+TX、溴-DDT(别名)[CCN]+TX、溴硫磷(920)+TX、溴硫磷-乙基(921)+TX、合杀威(924)+TX、噻嗪酮(99)+TX、畜虫威(926)+TX、特噻硫磷(butathiofos) (927)+TX、丁酮威(103)+TX、丁酯磷(932)+TX、丁酮砒威(104)+TX、丁基吡啶灵(别名)+TX、硫线磷(109)+TX、砷酸钙[CCN]+TX、氰化钙(444)+TX、多硫化钙(IUPAC名称) (111)+TX、毒杀芬(941)+TX、氯灭杀威(943)+TX、西维因(115)+TX、克百威(118)+TX、二硫化碳(IUPAC/化学文摘名) (945)+TX、四氯化碳(IUPAC名称) (946)+TX、三硫磷(947)+TX、丁硫克百威(119)+TX、杀螟丹(123)+TX、杀螟丹盐酸盐(123)+TX、藜芦碱(别名)(725)+TX、冰片丹(960)+TX、氯丹(128)+TX、十氯酮(963)+TX、杀虫脒(964)+TX、杀虫脒盐酸盐(964)+TX、氯氧磷(129)+TX、溴虫脒(130)+TX、毒虫畏(131)+TX、氟啶脒(132)+TX、氯甲磷(136)+TX、氯仿[CCN]+TX、氯化苦(141)+TX、氯腈脒磷(989)+TX、灭虫吡啶(chlorprazophos) (990)+TX、毒死蜱(145)+TX、甲基毒死蜱(146)+TX、虫螨磷(994)+TX、环虫酰肼(150)+TX、瓜菊酯I(696)+TX、瓜菊酯II(696)+TX、瓜菊酯(696)+TX、顺式苜蓿菊酯

(别名)+TX、苜呋菊酯(80)+TX、功夫菊酯(别名)+TX、除线威(999)+TX、氯氰碘柳胺(别名)[CCN]+TX、噻虫胺(165)+TX、乙酰亚砷酸铜[CCN]+TX、砷酸铜[CCN]+TX、油酸铜[CCN]+TX、蝇毒磷(174)+TX、畜虫磷(1006)+TX、克罗米通(别名)[CCN]+TX、丁烯磷(1010)+TX、育畜磷(1011)+TX、冰晶石(别名)(177)+TX、CS 708(开发代码)(1012)+TX、苯腈磷(1019)+TX、杀螟腈(184)+TX、果虫磷(1020)+TX、环虫菊[CCN]+TX、乙氰菊酯(188)+TX、氟氯氰菊酯(193)+TX、氯氟氰菊酯(196)+TX、氯氰菊酯(201)+TX、苯氰菊酯(206)+TX、灭蝇胺(209)+TX、赛灭磷(别名)[CCN]+TX、d-柠檬烯(别名)[CCN]+TX、d-胺菊酯(别名)(788)+TX、DAEP(1031)+TX、棉隆(216)+TX、DDT(219)+TX、二克百威(decarbofuran)(1034)+TX、溴氰菊酯(223)+TX、田乐磷(1037)+TX、田乐磷-0(1037)+TX、田乐磷-S(1037)+TX、内吸磷(1038)+TX、内吸磷-甲基(224)+TX、内吸磷-0(1038)+TX、内吸磷-0-甲基(224)+TX、内吸磷-S(1038)+TX、内吸磷-S-甲基(224)+TX、内吸磷-S-甲基砷(demeton-S-methylsulphon)(1039)+TX、杀螨隆(226)+TX、氯亚磷(1042)+TX、除线特(diamidafos)(1044)+TX、二嗪农(227)+TX、异氯磷(1050)+TX、除线磷(1051)+TX、敌敌畏(236)+TX、dicliphos(别名)+TX、dicresyl(别名)[CCN]+TX、百治磷(243)+TX、地昔尼尔(244)+TX、狄氏剂(1070)+TX、二乙基5-甲基吡唑-3-基磷酸酯(IUPAC名称)(1076)+TX、除虫脲(250)+TX、二羟丙茶碱(dilor)(别名)[CCN]+TX、四氟甲酯菊酯[CCN]+TX、甲氟磷(1081)+TX、地麦威(1085)+TX、乐果(262)+TX、苜菊酯(1083)+TX、甲基毒虫畏(265)+TX、敌蝇威(1086)+TX、消螨酚(1089)+TX、消螨酚-diclexine(1089)+TX、硝丙酚(1093)+TX、戊硝酚(1094)+TX、地乐酚(1095)+TX、呋虫胺(271)+TX、苯虫醚(1099)+TX、蔬果磷(1100)+TX、二氧威(1101)+TX、敌杀磷(1102)+TX、乙拌磷(278)+TX、dithicrofos(1108)+TX、DNOC(282)+TX、多拉克汀(别名)[CCN]+TX、DSP(1115)+TX、蜕皮甾酮(别名)[CCN]+TX、EI 1642(开发代码)(1118)+TX、甲氨基阿维菌素(291)+TX、甲氨基阿维菌素苯甲酸酯(291)+TX、EMPC(1120)+TX、烯炔菊酯(292)+TX、硫丹(294)+TX、因毒磷(1121)+TX、异狄氏剂(1122)+TX、EPBP(1123)+TX、EPN(297)+TX、保幼醚(1124)+TX、依立诺克丁(别名)[CCN]+TX、高氰戊菊酯(302)+TX、etaphos(别名)[CCN]+TX、杀虫丹(308)+TX、乙硫磷(309)+TX、乙虫腈(310)+TX、益硫磷(ethoate-methyl)(1134)+TX、灭线磷(312)+TX、甲酸乙酯(IUPAC名称)[CCN]+TX、乙基-DDD(别名)(1056)+TX、二溴化乙烯(316)+TX、二氯化乙烯(化学名)(1136)+TX、环氧乙烷[CCN]+TX、醚菊酯(319)+TX、乙嘧硫磷(1142)+TX、EXD(1143)+TX、氨磺磷(323)+TX、苯线磷(326)+TX、抗螨唑(1147)+TX、皮蝇磷(1148)+TX、双乙威(1149)+TX、芬氟司林(1150)+TX、杀螟硫磷(335)+TX、仲丁威(336)+TX、fenoxacrim(1153)+TX、苯氧威(340)+TX、吡氯氰菊酯(1155)+TX、甲氰菊酯(342)+TX、fenpyrad(别名)+TX、丰索磷(1158)+TX、倍硫磷(346)+TX、乙基倍硫磷[CCN]+TX、氰戊菊酯(349)+TX、氟虫腈(354)+TX、氟啶虫酰胺(358)+TX、氟虫双酰胺(CAS登记号:272451-65-7)+TX、氟氰戊菊酯(1168)+TX、氟螨脲(366)+TX、氟氰戊菊酯(367)+TX、联氟螨(1169)+TX、噻虫胺[CCN]+TX、氟虫脲(370)+TX、三氟醚菊酯(1171)+TX、氟氯苯菊酯(372)+TX、氟胺氰菊酯(1184)+TX、FMC 1137(开发代码)(1185)+TX、地虫磷(1191)+TX、伐虫脒(405)+TX、伐虫脒盐酸盐(405)+TX、安果(1192)+TX、formparanate(1193)+TX、丁苯硫磷(1194)+TX、福司吡酯(1195)+TX、噻唑磷(408)+TX、丁硫环磷(1196)+TX、呋线威(412)+TX、抗虫菊(1200)+TX、 $\gamma$ -氯氟氰菊酯(197)+TX、 $\gamma$ -HCH(430)+TX、双胍盐(422)+TX、双胍醋酸盐(422)+TX、GY-81(开发代码)(423)+TX、苜螨醚(424)+TX、氯虫酰胺(425)+TX、HCH(430)+TX、HEOD(1070)+TX、七氯(1211)+TX、庚烯醚(432)

+TX、速杀硫磷[CCN]+TX、氟铃脲(439)+TX、HHDN(864)+TX、伏蚁脘(443)+TX、氢氰酸(444)+TX、烯虫乙酯(445)+TX、喹啉威(hyquincarb)(1223)+TX、吡虫啉(458)+TX、咪炔菊酯(460)+TX、茛虫威(465)+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、IPSP(1229)+TX、氯唑磷(1231)+TX、碳氯灵(1232)+TX、水胺硫磷(别名)(473)+TX、异艾氏剂(1235)+TX、异柳磷(1236)+TX、异索威(isolan)(1237)+TX、异丙威(472)+TX、异丙基O-(甲氧基氨基硫代磷酸基)水杨酸酯(IUPAC名称)(473)+TX、稻瘟灵(474)+TX、异拌磷(1244)+TX、异恶唑磷(isoxathion)(480)+TX、伊维菌素(别名)[CCN]+TX、茛菊素I(696)+TX、茛菊素II(696)+TX、碘硫磷(1248)+TX、保幼激素I(别名)[CCN]+TX、保幼激素II(别名)[CCN]+TX、保幼激素III(别名)[CCN]+TX、克来范(1249)+TX、烯虫炔酯(484)+TX、 $\lambda$ -氯氟氰菊酯(198)+TX、砷酸铅[CCN]+TX、lepimectin(CCN)+TX、溴苯磷(1250)+TX、林丹(430)+TX、啉虫磷(lirimfos)(1251)+TX、虱螨脲(490)+TX、噻唑磷(1253)+TX、间异丙苯基甲基氨基甲酸酯(IUPAC名称)(1014)+TX、磷化镁(IUPAC名称)(640)+TX、马拉硫磷(492)+TX、丙螨氰(1254)+TX、叠氮磷(1255)+TX、灭蚜磷(502)+TX、甲基灭蚜磷(1258)+TX、灭蚜硫磷(1260)+TX、地胺磷(1261)+TX、氯化亚汞(513)+TX、甲亚砷磷(mesulfenfos)(1263)+TX、氰氟虫脘(CCN)+TX、百亩(别名)(519)+TX、百亩-钾盐(别名)(519)+TX、百亩-钠盐(519)+TX、虫螨畏(1266)+TX、甲胺磷(527)+TX、甲基磺酰氟(IUPAC/化学文摘名)(1268)+TX、杀扑磷(529)+TX、甲硫威(530)+TX、丁烯胺磷(methocrotophos)(1273)+TX、灭多威(531)+TX、烯虫酯(532)+TX、甲喹丁(methoquin-butyl)(1276)+TX、甲醚菊酯(别名)(别名)(533)+TX、甲氧滴滴涕(534)+TX、甲氧虫酰肼(535)+TX、溴甲烷(537)+TX、异硫氰酸甲酯(543)+TX、甲基氯仿(别名)[CCN]+TX、二氯甲烷[CCN]+TX、甲氧苄氟菊酯[CCN]+TX、速灭威(550)+TX、恶虫酮(metoxadiazone)(1288)+TX、速灭磷(556)+TX、自克威(1290)+TX、弥拜菌素(557)+TX、米尔贝肟(别名)[CCN]+TX、丙胺氟磷(1293)+TX、灭蚁灵(1294)+TX、久效磷(561)+TX、茂硫磷(1300)+TX、莫西菌素(别名)[CCN]+TX、奈肽磷(别名)[CCN]+TX、二溴磷(567)+TX、萘(IUPAC/化学文摘名)(1303)+TX、NC-170(开发代码)(1306)+TX、NC-184(化合物代码)+TX、烟碱(578)+TX、烟碱硫酸盐(578)+TX、氟蚊灵(1309)+TX、烯啉虫胺(579)+TX、硝虫噻嗪(nithiazine)(1311)+TX、戊氰威(1313)+TX、戊氰威1:1氯化锌复合物(1313)+TX、NNI-0101(化合物代码)+TX、NNI-0250(化合物代码)+TX、降烟碱(惯用名)(1319)+TX、双苯氟脲(585)+TX、多氟脲(586)+TX、0-5-二氯-4-碘苯基O-乙基乙基硫代磷酸酯(IUPAC名称)(1057)+TX、0,0-二乙基O-4-甲基-2-氧代-2H-色烯-7-基硫代磷酸酯(IUPAC名称)(1074)+TX、0,0-二乙基O-6-甲基-2-丙基嘧啶-4-基硫代磷酸酯(IUPAC名称)(1075)+TX、0,0,0',0'-四丙基二硫代焦磷酸酯(IUPAC名称)(1424)+TX、油酸(IUPAC名称)(593)+TX、氧化乐果(594)+TX、草氨酰(602)+TX、砷吸磷(oxydemeton-methyl)(609)+TX、异亚砷磷(1324)+TX、砷拌磷(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、对二氯苯[CCN]+TX、对硫磷(615)+TX、对硫磷-甲基(616)+TX、氟幼脲(别名)[CCN]+TX、五氯苯酚(623)+TX、五氯苯基月桂酸酯(IUPAC名称)(623)+TX、苄氯菊酯(626)+TX、石油(别名)(628)+TX、PH 60-38(开发代码)(1328)+TX、酚硫磷(phenkapton)(1330)+TX、苯醚菊酯(630)+TX、稻丰散(631)+TX、甲拌磷(636)+TX、伏杀硫磷(637)+TX、硫环磷(1338)+TX、亚胺硫磷(638)+TX、对氯硫磷(1339)+TX、磷胺(639)+TX、磷化氢(IUPAC名称)(640)+TX、辛硫磷(642)+TX、辛硫磷-甲基(1340)+TX、甲胺嘧磷(pirimetaphos)(1344)+TX、抗蚜威(651)+TX、乙基嘧啶磷(1345)+TX、甲基嘧啶磷(652)+TX、多氯二环戊二烯异构体(IUPAC名称)(1346)+

TX、多氯萘烯(惯用名)(1347)+TX、亚砷酸钾[CCN]+TX、硫氰酸钾[CCN]+TX、炔丙菊酯(655)+TX、早熟素I(别名)[CCN]+TX、早熟素II(别名)[CCN]+TX、早熟素III(别名)[CCN]+TX、乙酰嘧啶磷(primidophos)(1349)+TX、丙溴磷(662)+TX、丙氟菊酯(profluthrin)[CCN]+TX、吡虱威(1354)+TX、猛杀威(1355)+TX、丙虫磷(1356)+TX、胺丙畏(673)+TX、残杀威(678)+TX、乙噻唑磷(1360)+TX、丙硫磷(686)+TX、发果(1362)+TX、丙苯炔菊酯(protrifenbute)[CCN]+TX、吡蚜酮(688)+TX、吡啶硫磷(689)+TX、定菌磷(693)+TX、反灭虫菊(pyresmethrin)(1367)+TX、除虫菊酯I(696)+TX、除虫菊酯II(696)+TX、除虫菊酯(696)+TX、哒螨灵(699)+TX、啶虫丙醚(700)+TX、哒嗪硫磷(701)+TX、噻螨醚(706)+TX、噻硫磷(1370)+TX、蚊蝇醚(708)+TX、苦木(别名)[CCN]+TX、喹硫磷(711)+TX、喹硫磷-甲基(1376)+TX、畜宁磷(quinotion)(1380)+TX、喹硫磷(1381)+TX、R-1492(开发代码)(1382)+TX、碘醚柳胺(别名)[CCN]+TX、苜味菊脂(719)+TX、鱼藤酮(722)+TX、RU 15525(开发代码)(723)+TX、RU 25475(开发代码)(1386)+TX、鱼尼丁(别名)(1387)+TX、利阿诺定(惯用名)(1387)+TX、藜芦碱(别名)(725)+TX、八甲磷(1389)+TX、克线丹(别名)+TX、司拉克丁(别名)[CCN]+TX、SI-0009(化合物代码)+TX、SI-0205(化合物代码)+TX、SI-0404(化合物代码)+TX、SI-0405(化合物代码)+TX、氟硅菊酯(728)+TX、SN 72129(开发代码)(1397)+TX、亚砷酸钠[CCN]+TX、氰化钠(444)+TX、氟化钠(IUPAC/化学文摘名)(1399)+TX、氟硅酸钠(1400)+TX、五氯酚钠(623)+TX、硒酸钠(IUPAC名称)(1401)+TX、硫氰酸钠[CCN]+TX、苏硫磷(1402)+TX、多杀菌素(737)+TX、螺甲螨酯(739)+TX、螺虫乙酯(spirotetramat)(CCN)+TX、sulcofuron(746)+TX、sulcofuron-sodium(746)+TX、氟虫胺(750)+TX、治螟磷(753)+TX、磺酰氟(756)+TX、硫丙磷(1408)+TX、焦油(别名)(758)+TX、氟胺氰菊酯(398)+TX、噻螨威(1412)+TX、TDE(1414)+TX、虫酰肼(762)+TX、吡螨胺(763)+TX、丁基嘧啶磷(764)+TX、氟苯脲(768)+TX、七氟菊酯(769)+TX、双硫磷(770)+TX、TEPP(1417)+TX、环戊烯丙菊酯(1418)+TX、叔丁威(别名)+TX、特丁磷(773)+TX、四氯乙烷[CCN]+TX、杀虫畏(777)+TX、胺菊酯(787)+TX、高效反式氯氰菊酯(204)+TX、噻虫啉(791)+TX、thiafenox(别名)+TX、噻虫嗪(792)+TX、噻氯磷(thicrofos)(1428)+TX、抗虫威(1431)+TX、杀虫环(798)+TX、杀虫环草酸盐(798)+TX、硫双威(799)+TX、久效威(800)+TX、甲基乙拌磷(801)+TX、虫线磷(1434)+TX、杀虫单(thiosultap)(803)+TX、杀虫双(thiosultap-sodium)(803)+TX、苏云金素(别名)[CCN]+TX、啉虫酰胺(809)+TX、四溴菊酯(812)+TX、四氟苯菊酯(813)+TX、transpermethrin(1440)+TX、三唑磷胺(1441)+TX、啉蚜威(818)+TX、三唑磷(820)+TX、triazuron(别名)+TX、敌百虫(824)+TX、trichlormetaphos-3(别名)[CCN]+TX、毒壤磷(1452)+TX、三氯丙氧磷(trifenofos)(1455)+TX、杀铃脲(835)+TX、混杀威(840)+TX、烯虫硫酯(1459)+TX、蚜灭多(847)+TX、氟吡啶虫(vaniliprole)[CCN]+TX、藜芦定(别名)(725)+TX、藜芦碱(别名)(725)+TX、XMC(853)+TX、灭杀威(854)+TX、YI-5302(化合物代码)+TX、ζ-氯氰菊酯(205)+TX、zetamethrin(别名)+TX、磷化锌(640)+TX、zolaprofos(1469)和ZXI 8901(开发代码)(858)+TX、氰虫酰胺[736994-63-19]+TX、氯虫苯甲酰胺[500008-45-7]+TX、腈吡螨酯[560121-52-0]+TX、丁氟螨酯[400882-07-7]+TX、新啉啉(pyrifluquinazon)[337458-27-2]+TX、乙基多杀菌素[187166-40-1+187166-15-0]+TX、螺虫乙酯[203313-25-1]+TX、砒虫啉[946578-00-3]+TX、丁虫腈[704886-18-0]+TX、氯氟醚菊酯[915288-13-0]+TX、四氟醚菊酯[84937-88-2]+TX、三氟苯啉啉(triflumezopyrim)(披露于WO 2012/092115中)+TX,

[0351] 杀软体动物剂,该杀软体动物剂选自由以下组成的物质组:二(三丁基锡)氧化物(IUPAC名称)(913)+TX、溴乙酰胺[CCN]+TX、磷酸钙[CCN]+TX、除线威(cloethocarb)(999)+TX、乙酰亚砷酸铜[CCN]+TX、硫酸铜(172)+TX、三苯锡(347)+TX、磷酸铁(IUPAC名称)(352)+TX、四聚乙醛(518)+TX、灭虫威(530)+TX、氯硝柳胺(576)+TX、氯硝柳胺乙醇胺盐(576)+TX、五氯酚(623)+TX、五氯苯氧化钠(623)+TX、噻螨威(tazimcarb)(1412)+TX、硫双威(799)+TX、三丁基氧化锡(913)+TX、杀螺吗啉(trifenmorph)(1454)+TX、混杀威(trimethacarb)(840)+TX、乙酸三苯基锡(IUPAC名称)(347)和三苯基氢氧化锡(IUPAC名称)(347)+TX、皮瑞普(pyriprole)[394730-71-3]+TX,

[0352] 杀线虫剂,该杀线虫剂选自由以下组成的物质组:AKD-3088(化合物代码)+TX、1,2-二溴-3-氯丙烷(IUPAC/化学文摘名称)(1045)+TX、1,2-二氯丙烷(IUPAC/化学文摘名称)(1062)+TX、1,2-二氯丙烷与1,3-二氯丙烯(IUPAC名称)(1063)+TX、1,3-二氯丙烯(233)+TX、3,4-二氯四氢噻吩1,1-二氧化物(IUPAC/化学文摘名称)(1065)+TX、3-(4-氯苯基)-5-甲基罗丹宁(IUPAC名称)(980)+TX、5-甲基-6-硫代-1,3,5-噻二嗪烷-3-基乙酸(IUPAC名称)(1286)+TX、6-异戊烯基氨基嘌呤(别名)(210)+TX、阿巴美丁(1)+TX、乙酰虫腈[CCN]+TX、棉铃威(15)+TX、涕灭威(aldicarb)(16)+TX、涕灭砒威(863)+TX、AZ 60541(化合物代码)+TX、苯氯噻唑(benclothiaz)[CCN]+TX、苯菌灵(62)+TX、丁基吡螨灵(别名)+TX、硫线磷(109)+TX、虫螨威(carbofuran)(118)+TX、二硫化碳(945)+TX、丁硫克百威(119)+TX、三氯硝基甲(141)+TX、毒死蜱(145)+TX、除线威(999)+TX、细胞分裂素(别名)(210)+TX、棉隆(216)+TX、DBCP(1045)+TX、DCIP(218)+TX、除线特(diamidafos)(1044)+TX、除线磷(1051)+TX、二克磷(dicliphos)(别名)+TX、乐果(262)+TX、多拉菌素(别名)[CCN]+TX、埃玛菌素(291)+TX、埃玛菌素苯甲酸盐(291)+TX、依立诺克丁(别名)[CCN]+TX、灭线磷(312)+TX、二溴化乙烯(316)+TX、克线磷(326)+TX、吡螨胺(fenpyrad)(别名)+TX、丰索磷(1158)+TX、噻唑磷(408)+TX、丁硫环磷(1196)+TX、糠醛(别名)[CCN]+TX、GY-81(开发代码)(423)+TX、速杀硫磷[CCN]+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、艾沙米多福(isamidofos)(1230)+TX、氯唑磷(1231)+TX、伊佛霉素(别名)[CCN]+TX、激动素(别名)(210)+TX、甲基减蚜磷(1258)+TX、威百亩(519)+TX、威百亩钾盐(别名)(519)+TX、威百亩钠盐(519)+TX、甲基溴(537)+TX、甲基异硫氰酸酯(543)+TX、米尔贝肟(别名)[CCN]+TX、莫昔克丁(别名)[CCN]+TX、疣孢漆斑菌(Myrothecium verrucaria)组合物(别名)(565)+TX、NC-184(化合物代码)+TX、草氨酰(602)+TX、甲拌磷(636)+TX、磷胺(639)+TX、磷虫威[CCN]+TX、克线丹(别名)+TX、司拉克丁(别名)[CCN]+TX、多杀菌素(737)+TX、叔丁威(别名)+TX、特丁磷(773)+TX、四氯噻吩(IUPAC/化学文摘名称)(1422)+TX、thiafenox(别名)+TX、硫磷嗪(1434)+TX、三唑磷(820)+TX、啮蚜威(别名)+TX、二甲苯酚[CCN]+TX、YI-5302(化合物代码)和玉米素(别名)(210)+TX、氟噻虫砒(fluensulfone)[318290-98-1]+TX,

[0353] 硝化抑制剂,该硝化抑制剂选自由以下组成的物质组:乙基黄原酸钾[CCN]以及氯啶(nitrapyrin)(580)+TX,

[0354] 植物激活剂,该植物激活剂选自由以下组成的物质组:噻二唑素(acibenzolar)(6)+TX、噻二唑素-S-甲基(6)+TX、烯丙苯噻唑(probenazole)(658)和大虎杖(Reynoutria sachalinensis)提取物(别名)(720)+TX,

[0355] 杀鼠剂,该杀鼠剂选自由以下组成的物质组:2-异戊酰茛满-1,3-二酮(IUPAC名

称) (1246) +TX、4-(喹啉-2-基氨基) 苯磺酰胺 (IUPAC 名称) (748) +TX、 $\alpha$ -氯代醇 [CCN] +TX、磷化铝 (640) +TX、安妥 (880) +TX、三氧化二砷 (882) +TX、碳酸钡 (891) +TX、双鼠脲 (912) +TX、溴鼠隆 (89) +TX、溴敌隆 (91) +TX、溴鼠胺 (92) +TX、氰化钙 (444) +TX、氮醛糖 (127) +TX、氯鼠酮 (140) +TX、胆钙化醇 (别名) (850) +TX、氯灭鼠灵 (1004) +TX、克灭鼠 (1005) +TX、杀鼠茶 (175) +TX、杀鼠啉 (1009) +TX、鼠得克 (246) +TX、噻鼠灵 (249) +TX、敌鼠钠 (273) +TX、钙化醇 (301) +TX、氟鼠灵 (357) +TX、氟乙酰胺 (379) +TX、氟鼠啉 (1183) +TX、盐酸氟鼠啉 (1183) +TX、 $\gamma$ -HCH (430) +TX、HCH (430) +TX、氢氰酸 (444) +TX、碘甲烷 (IUPAC 名称) (542) +TX、林旦 (430) +TX、磷化镁 (IUPAC 名称) (640) +TX、甲基溴 (537) +TX、鼠特灵 (1318) +TX、毒鼠磷 (1336) +TX、磷化氢 (IUPAC 名称) (640) +TX、磷 [CCN] +TX、杀鼠酮 (1341) +TX、亚砷酸钾 [CCN] +TX、灭鼠优 (1371) +TX、海葱糖苷 (1390) +TX、亚砷酸钠 [CCN] +TX、氰化钠 (444) +TX、氟乙酸钠 (735) +TX、士的宁 (745) +TX、硫酸铊 [CCN] +TX、杀鼠灵 (851) 和磷化锌 (640) +TX,

[0356] 增效剂, 该增效剂选自由以下组成的物质组: 2-(2-丁氧基乙氧基) 乙基胡椒基酯 (IUPAC 名称) (934) +TX、5-(1,3-苯并二氧杂环戊烯-5-基)-3-己基环己-2-烯酮 (IUPAC 名称) (903) +TX、具有橙花叔醇的法呢醇 (别名) (324) +TX、MB-599 (开发代码) (498) +TX、MGK 264 (开发代码) (296) +TX、增效醚 (piperonyl butoxide) (649) +TX、增效醛 (piprotal) (1343) +TX、增效酯 (propyl isomer) (1358) +TX、S421 (开发代码) (724) +TX、增效散 (sesamex) (1393) +TX、芝麻林素 (sesamol) (1394) 和亚砷 (1406) +TX,

[0357] 动物驱避剂, 该动物驱避剂选自由以下组成的物质组: 蒽醌 (32) +TX、氯醛糖 (127) +TX、环烷酸铜 [CCN] +TX、王铜 (171) +TX、二嗪磷 (227) +TX、二环戊二烯 (化学名称) (1069) +TX、双胍盐 (guazatine) (422) +TX、双胍醋酸盐 (422) +TX、灭虫威 (530) +TX、吡啉-4-胺 (IUPAC 名称) (23) +TX、塞仑 (804) +TX、混杀威 (trimethacarb) (840) +TX、环烷酸锌 [CCN] 和福美锌 (856) +TX,

[0358] 杀病毒剂, 该杀病毒剂选自由以下组成的物质组: 衣马宁 (别名) [CCN] 和利巴韦林 (别名) [CCN] +TX,

[0359] 创伤保护剂, 该创伤保护剂选自由以下组成的物质组: 氧化汞 (512) +TX、辛噻酮 (590) 和甲基硫菌灵 (802) +TX,

[0360] 以及生物活性化合物, 该生物活性化合物选自由以下物质组成的组: 唑啉菌胺 [865318-97-4] +TX、吡啉菌胺 [348635-87-0] +TX、阿扎康唑 [60207-31-0] +TX、苯并烯氟菌唑 (benzovindiflupyr) [1072957-71-1] +TX、联苯三唑醇 [70585-36-3] +TX、联苯吡菌胺 [581809-46-3] +TX、糠菌唑 [116255-48-2] +TX、丁香菌酯 [850881-70-8] +TX、环唑醇 [94361-06-5] +TX、苯醚甲环唑 [119446-68-3] +TX、烯唑醇 [83657-24-3] +TX、烯肟菌酯 [238410-11-2] +TX、氟环唑 [106325-08-0] +TX、腈苯唑 [114369-43-6] +TX、胺苯吡菌酮 [473798-59-3] +TX、氟唑唑 [136426-54-5] +TX、氟硅唑 [85509-19-9] +TX、粉唑醇 [76674-21-0] +TX、氟唑菌酰胺 [907204-31-3] +TX、氟吡菌酰胺 [658066-35-4] +TX、烯肟菌胺 [366815-39-6] +TX、异丙噻菌胺 (isofetamid) [875915-78-9] +TX、己唑醇 [79983-71-4] +TX、抑霉唑 [35554-44-0] +TX、亚胺唑 [86598-92-7] +TX、种菌唑 [125225-28-7] +TX、ipfentrifluconazole [1417782-08-1] +TX、异噻菌胺 [224049-04-1] +TX、mandestrobin [173662-97-0] (可以根据在 W0 2010/093059 中描述的程序制备) +TX、mefentrifluconazole [1417782-03-6] +TX、叶菌唑 [125116-23-6] +TX、腈菌唑 [88671-89-

0]+TX、多效唑[76738-62-0]+TX、稻瘟酯[101903-30-4]+TX、戊苯吡菌胺[494793-67-8]+TX、戊菌唑[66246-88-6]+TX、丙硫菌唑[178928-70-6]+TX、啉斑肟(pyrifenoxy)[88283-41-4]+TX、丙氯灵[67747-09-5]+TX、丙环唑[60207-90-1]+TX、硅氟唑(simeconazole)[149508-90-7]+TX、戊唑醇[107534-96-3]+TX、氟醚唑[112281-77-3]+TX、三唑酮[43121-43-3]+TX、三唑酮[55219-65-3]+TX、氟菌唑[99387-89-0]+TX、灭菌唑[131983-72-7]+TX、三环苯嘧啶醇[12771-68-5]+TX、氯苯嘧啶醇[60168-88-9]+TX、氟氯苯嘧啶醇[63284-71-9]+TX、乙嘧酚磺酸酯(bupirimate)[41483-43-6]+TX、甲菌定(dimethirimol)[5221-53-4]+TX、乙菌定(ethirimol)[23947-60-6]+TX、十二环吗啉[1593-77-7]+TX、苯锈啶(fenpropidin)[67306-00-7]+TX、丁苯吗啉[67564-91-4]+TX、螺环菌胺[118134-30-8]+TX、十三吗啉[81412-43-3]+TX、嘧菌环胺[121552-61-2]+TX、嘧菌胺[110235-47-7]+TX、嘧霉胺(pyrimethanil)[53112-28-0]+TX、拌种咯[74738-17-3]+TX、咯菌腈(fludioxonil)[131341-86-1]+TX、氟茚唑菌胺(fluidinapyr)[1383809-87-7]+TX、苯霜灵(benlaxyl)[71626-11-4]+TX、呋霜灵(furalaxyl)[57646-30-7]+TX、甲霜灵[57837-19-1]+TX、R-甲霜灵[70630-17-0]+TX、呋酰胺[58810-48-3]+TX、恶霜灵(Oxadixyl)[77732-09-3]+TX、苯菌灵[17804-35-2]+TX、多菌灵[10605-21-7]+TX、咪菌威(debacarb)[62732-91-6]+TX、麦穗宁[3878-19-1]+TX、噻苯达唑[148-79-8]+TX、乙菌利(chlozolinate)[84332-86-5]+TX、菌核利(dichlozoline)[24201-58-9]+TX、异菌脲(Iprodione)[36734-19-7]+TX、甲菌利(myclozoline)[54864-61-8]+TX、腐霉利(procymidone)[32809-16-8]+TX、乙烯菌核利(vinclozoline)[50471-44-8]+TX、啉酰菌胺(boscalid)[188425-85-6]+TX、萎锈灵[5234-68-4]+TX、甲呋酰苯胺[24691-80-3]+TX、福多宁(flutolanil)[66332-96-5]+TX、氟酰胺(Flutolanil)[958647-10-4]+TX、灭锈胺[55814-41-0]+TX、氧化萎锈灵[5259-88-1]+TX、吡噻菌胺(penthiopyrad)[183675-82-3]+TX、噻呋菌胺[130000-40-7]+TX、双胍盐[108173-90-6]+TX、多果定(dodine)[2439-10-3][112-65-2](游离碱)+TX、双胍辛胺(iminoctadine)[13516-27-3]+TX、嘧菌酯[131860-33-8]+TX、醚菌胺[149961-52-4]+TX、烯肟菌酯{Proc.BCPC,Int.Congr.,Glasgow.2003,1,93}+TX、氟嘧菌酯[361377-29-9]+TX、甲基醚菌酯[143390-89-0]+TX、苯氧菌胺[133408-50-1]+TX、肟菌酯[141517-21-7]+TX、肟醚菌胺[248593-16-0]+TX、啉氧菌酯[117428-22-5]+TX、唑菌胺酯[175013-18-0]+TX、唑菌酯[862588-11-2]+TX、福美铁[14484-64-1]+TX、代森锰锌[8018-01-7]+TX、代森锰[12427-38-2]+TX、代森联[9006-42-2]+TX、甲代森锌(propineb)[12071-83-9]+TX、塞仑[137-26-8]+TX、代森锌[12122-67-7]+TX、福美锌[137-30-4]+TX、敌菌丹(captafol)[2425-06-1]+TX、克菌丹[133-06-2]+TX、苯氟磺胺[1085-98-9]+TX、啉啉草(fluoroimide)[41205-21-4]+TX、灭菌丹[133-07-3]+TX、甲苯氟磺胺[731-27-1]+TX、波尔多(bordeaux)混合物[8011-63-0]+TX、氢氧化铜(copperhydroxid)[20427-59-2]+TX、氯化铜(copperoxychlorid)[1332-40-7]+TX、硫酸铜(coppersulfat)[7758-98-7]+TX、氧化铜(copperoxid)[1317-39-1]+TX、代森锰铜(mancopper)[53988-93-5]+TX、喹啉铜(oxine-copper)[10380-28-6]+TX、敌螨普(dinocap)[131-72-6]+TX、酞菌酯(硝基thal-isopropyl)[10552-74-6]+TX、克瘟散[17109-49-8]+TX、异稻瘟净(iprobenphos)[26087-47-8]+TX、稻瘟灵(isoprothiolane)[50512-35-1]+TX、氯瘟磷(phosdiphen)[36519-00-3]+TX、克菌磷(pyrazophos)[13457-18-6]+TX、甲基托氯磷(tolclofos-甲基)[57018-04-9]+TX、苯并噻二唑(acibenzolar-S-

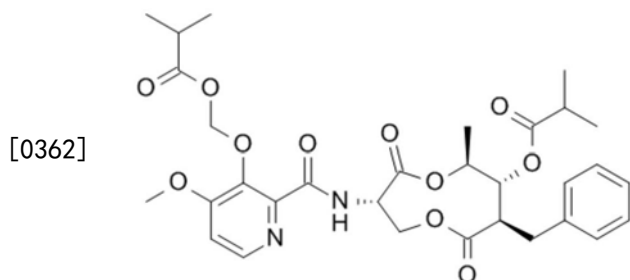


甲基) [135158-54-2]+TX、敌菌灵[101-05-3]+TX、苯噻菌胺[413615-35-7]+TX、灭瘟素(blasticidin)-S[2079-00-7]+TX、灭螨猛(chinomethionat)[2439-01-2]+TX、地茂散(chloroneb)[2675-77-6]+TX、百菌清[1897-45-6]+TX、环氟菌胺[180409-60-3]+TX、霜脍氰[57966-95-7]+TX、二氯荼醌(dichlone)[117-80-6]+TX、双氯氰菌胺(diclocymet)[139920-32-4]+TX、哒菌酮(diclomezine)[62865-36-5]+TX、氯硝胺(dicloran)[99-30-9]+TX、乙霉威(diethofencarb)[87130-20-9]+TX、烯酰吗啉[110488-70-5]+TX、SYP-LI90(Flumorph)[211867-47-9]+TX、二噻农(dithianon)[3347-22-6]+TX、噻唑菌胺(ethaboxam)[162650-77-3]+TX、土菌灵(etridiazole)[2593-15-9]+TX、恶唑菌酮[131807-57-3]+TX、咪唑菌酮(fenamidone)[161326-34-7]+TX、稻瘟酰胺(Fenoxanil)[115852-48-7]+TX、三苯锡(fentin)[668-34-8]+TX、噻菌脲(ferimzone)[89269-64-7]+TX、氟啶胺(fluazinam)[79622-59-6]+TX、氟吡菌胺(fluopicolide)[239110-15-7]+TX、磺菌胺(flusulfamide)[106917-52-6]+TX、环酰菌胺[126833-17-8]+TX、福赛得(fosetyl-aluminium)[39148-24-8]+TX、恶霉灵(hymexazol)[10004-44-1]+TX、丙森锌[140923-17-7]+TX、IKF-916(赛座灭(Cyazofamid))[120116-88-3]+TX、春雷霉素(kasugamycin)[6980-18-3]+TX、磺菌威(methasulfocarb)[66952-49-6]+TX、苯菌酮[220899-03-6]+TX、戊菌隆(pencycuron)[66063-05-6]+TX、稻瘟酞[27355-22-2]+TX、picarbutrazox[500207-04-5]+TX、多氧霉素(polyoxins)[11113-80-7]+TX、噻菌灵(probenazole)[27605-76-1]+TX、百维威(propamocarb)[25606-41-1]+TX、碘啶唑酮(proquinazid)[189278-12-4]+TX、吡啶氟美芬(pydiflumetofen)[1228284-64-7]+TX、唑胺菌酯[915410-70-7]+TX、咯啶酮(pyroquilon)[57369-32-1]+TX、pyriofenone[688046-61-9]+TX、吡菌苯威[799247-52-2]+TX、啶菌恶唑[847749-37-5]+TX、啶氧灵[124495-18-7]+TX、五氯硝苯[82-68-8]+TX、硫[7704-34-9]+TX、Timorex Gold™(来自斯托克顿集团(Stockton Group)的含有茶树油的植物提取物)+TX、tebufloquin[376645-78-2]+TX、噻酰菌胺[223580-51-6]+TX、咪唑啉(triazoxide)[72459-58-6]+TX、tolprocarb[911499-62-2]+TX、氯啶菌酯[902760-40-1]+TX、三环唑[41814-78-2]+TX、啶菌灵[26644-46-2]+TX、有效霉素[37248-47-8]+TX、霜霉灭(valifenalate)[283159-90-0]+TX、苯酰菌胺(zoxamide)(RH7281)[156052-68-5]+TX、双炔酰菌胺(mandipropamid)[374726-62-2]+TX、吡蚜酮(isopyrazam)[881685-58-1]+TX、氰烯菌酯+TX、塞德因(sedaxane)[874967-67-6]+TX、抗倒酯(trinexapac-ethyl)[95266-40-3]+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶-4-羧酸(9-二氯亚甲基-1,2,3,4-四氢-1,4-桥亚甲基-萘-5-基)-酰胺(披露于W0 2007/048556中)+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶-4-羧酸(3',4',5'-三氟-联苯基-2-基)-酰胺(披露于W0 2006/087343中)+TX、[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[(环丙基羰基)氧基]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氢-6,12-二羟基-4,6a,12b-三甲基-11-氧代-9-(3-吡啶基)-2H,11H萘并[2,1-b]吡喃并[3,4-e]吡喃-4-基]甲基-环丙甲酸酯[915972-17-7]+TX以及1,3,5-三甲基-N-(2-甲基-1-氧丙基)-N-[3-(2-甲基丙基)-4-[2,2,2-三氟-1-甲氧基-1-(三氟甲基)乙基]苯基]-1H-吡啶-4-甲酰胺[926914-55-8]+TX,

[0361] 或生物活性化合物,该生物活性化合物选自由以下组成的组:N-[(5-氯-2-异丙基-苯基)甲基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-吡啶-4-甲酰胺(可以根据在W0 2010/130767中所述的程序来制备)+TX、2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二硫杂[2,3-c:5,6-c']

二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮(可以根据在WO 2011/138281中所述的程序来制备)+TX、6-乙基-5,7-二氧化代-吡咯并[4,5][1,4]二硫杂[1,2-c]异噻唑-3-甲腈+TX、4-(2-溴-4-氟-苯基)-N-(2-氯-6-氟-苯基)-2,5-二甲基-吡唑-3-胺(可以根据在WO 2012/031061中所述的程序来制备)+TX、3-(二氟甲基)-N-(7-氟-1,1,3-三甲基-茛满-4-基)-1-甲基-吡唑-4-甲酰胺(可以根据在WO 2012/084812中所述的程序来制备)+TX、CAS 850881-30-0+TX、3-(3,4-二氯-1,2-噻唑-5-基甲氧基)-1,2-苯并噻唑1,1-二氧化物(可以根据在WO 2007/129454中所述的程序来制备)+TX、2-[2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基]-2-甲氧基-N-甲基-乙酰胺+TX、3-(4,4-二氟-3,4-二氢-3,3-二甲基异喹啉-1-基)喹诺酮(可以根据在WO 2005/070917中所述的程序来制备)+TX、2-[2-氟-6-[(8-氟-2-甲基-3-喹啉基)氧基]苯基]丙-2-醇(可以根据在WO 2011/081174中所述的程序来制备)+TX、2-[2-[(7,8-二氟-2-甲基-3-喹啉基)氧基]-6-氟-苯基]丙-2-醇(可以根据在WO 2011/081174中所述的程序来制备)+TX、欧塞匹林(oxathiapiprolin)+TX[1003318-67-9]、叔-丁基N-[6-[[[(1-甲基四唑-5-基)-苯基-亚甲基]氨基]氧基甲基]-2-吡啶基]氨基甲酸酯+TX、N-[2-(3,4-二氟苯基)苯基]-3-(三氟甲基)吡嗪-2-甲酰胺(可以根据在WO 2007/072999中所述的程序来制备)+TX、3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基茛满-4-基]吡唑-4-甲酰胺(可以根据在WO 2014/013842中所述的程序来制备)+TX、2,2,2-三氟乙基N-[2-甲基-1-[[4-甲基苯甲酰基]氨基]甲基]丙基]氨基甲酸酯+TX、(2RS)-2-[4-(4-氯苯氧基)- $\alpha,\alpha,\alpha$ -三氟-o-甲苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇+TX、(2RS)-2-[4-(4-氯苯氧基)- $\alpha,\alpha,\alpha$ -三氟-o-甲苯基]-3-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇+TX、2-(二氟甲基)-N-[(3R)-3-乙基-1,1-二甲基-茛满-4-基]吡啶-3-甲酰胺+TX、N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-(4-(4,5-二氯噻唑-2-基)氧基-2,5-二甲基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒(可以根据在WO 2007/031513中所述的程序来制备)+TX、[2-[3-[2-[1-[2-[3,5-双(二氟甲基)吡唑-1-基]乙酰基]-4-哌啶基]噻唑-4-基]-4,5-二氢异噻唑-5-基]-3-氯-苯基]甲烷磺酸酯(可以根据在WO 2012/025557中所述的程序来制备)+TX、丁-3-炔基N-[6-[[Z)-[(1-甲基四唑-5-基)-苯基-亚甲基]氨基]氧基甲基]-2-吡啶基]氨基甲酸酯(可以根据在WO 2010/000841中所述的程序来制备)+TX、2-[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基]-4H-1,2,4-三唑-3-硫酮(可以根据在WO 2010/146031中所述的程序来制备)+TX、甲基N-[[5-[4-(2,4-二甲基苯基)三唑-2-基]-2-甲基-苯基]甲基]氨基甲酸酯+TX、3-氯-6-甲基-5-苯基-4-(2,4,6-三氟苯基)哒嗪(可以根据在WO 2005/121104中所述的程序来制备)+TX、2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇(可以根据在WO 2013/024082中所述的程序来制备)+TX、3-氯-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基-5-苯基-哒嗪(可以根据在WO 2012/020774中所述的程序来制备)+TX、4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基-5-苯基-哒嗪-3-甲腈(可以根据在WO 2012/020774中所述的程序来制备)+TX、(R)-3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[1,1,3-三甲基茛满-4-基]吡唑-4-甲酰胺(可以根据在WO 2011/162397中所述的程序来制备)+TX、3-(二氟甲基)-N-(7-氟-1,1,3-三甲基-茛满-4-基)-1-甲基-吡唑-4-甲酰胺(可以根据在WO 2012/084812中所述的程序来制备)+TX、1-[2-[[1-(4-氯苯基)吡唑-3-基]氧基甲基]-3-甲基-苯基]-4-甲基-四唑-5-酮(可以根据在WO 2013/162072中所述的程序来制备)+TX、1-甲基-4-[3-甲基-2-[[2-甲基-4-(3,4,5-三甲基吡唑-1-基)苯氧基]甲基]苯基]四唑-5-

酮(可以根据在WO 2014/051165中所述的程序来制备)+TX、(Z,2E)-5-[1-(4-氯苯基)吡啶-3-基]氧基-2-甲氧基氨基-N,3-二甲基-戊-3-烯酰胺+TX、(4-苯氧基苯基)甲基2-氨基-6-甲基-吡啶-3-甲酸酯+TX、N-(5-氯-2-异丙基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基吡啶-4-甲酰胺[1255734-28-1](可以根据在WO 2010/130767中所述的程序来制备)+TX、3-(二氟甲基)-N-[(R)-2,3-二氢-1,1,3-三甲基-1H-茛-4-基]-1-甲基吡啶-4-甲酰胺[1352994-67-2]+TX、N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-(4-(4,5-二氯-噻唑-2-基氧基)-2,5-二甲基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-(4-(4,5-二氯-噻唑-2-基氧基)-2,5-二甲基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、



(fencicoxamid[517875-34-2](如WO2003/035617中所述)+TX、(1S)-2,2-双(4-氟苯基)-1-甲基乙基N-{[3-(乙酰氧基)-4-甲氧基-2-吡啶基]羧基}-L-氨基丙酸乙酯[1961312-55-9](如WO 2016/122802中所述)+TX、2-(二氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基茛满-4-基)吡啶-3-甲酰胺+TX、2-(二氟甲基)-N-(3-乙基-1,1-二甲基-茛满-4-基)吡啶-3-甲酰胺+TX、2-(二氟甲基)-N-(1,1-二甲基-3-丙基-茛满-4-基)吡啶-3-甲酰胺+TX、2-(二氟甲基)-N-(3-异丁基-1,1-二甲基-茛满-4-基)吡啶-3-甲酰胺+TX、2-(二氟甲基)-N-[(3R)-1,1,3-三甲基茛满-4-基]吡啶-3-甲酰胺+TX、2-(二氟甲基)-N-[(3R)-3-乙基-1,1-二甲基-茛满-4-基]吡啶-3-甲酰胺+TX、以及2-(二氟甲基)-N-[(3R)-1,1-二甲基-3-丙基-茛满-4-基]吡啶-3-甲酰胺+TX,其中,这些甲酰胺化合物中的每一种都可以根据WO 2014/095675和/或WO 2016/139189中所述的程序来制备。

[0363] 在活性成分之后的括号中的参考,例如[3878-19-1]是指化学文摘登记号。上文描述的混合配伍物是已知的。当活性成分包括在“The Pesticide Manual[杀有害生物剂手册]”[The Pesticide Manual-AWorld Compendium[杀有害生物剂手册-全球概览];第13版;编辑:C.D.S.Tomlin;The British Crop Protection Coimcil[英国农作物保护委员会]]中,它们在其中以上文对于特定化合物的圆括号中所给出的条目编号来描述;例如化合物“阿巴美丁”以条目编号(1)来描述。其中“[CCN]”是对于上文的特定化合物来加上的,该化合物包括在“Compendium of Pesticide Common Names[农药通用名概要]”中,其可以在互联网[A.Wood;Compendium of Pesticide Common Names, Copyright ©1995-2004]上获得;例如,化合物“乙酰虫脒”描述于互联网地址<http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>中。

[0364] 多数以上描述的活性成分通过上文中所谓的“通用名”来表示,在不同的情形中使用相应的“ISO通用名”或其它“通用名”。若名称不是“通用名”,则所使用的名称种类以特定化合物的圆括号中所给出的名称来代替;在这种情况下,使用IUPAC名称、IUPAC/化学文摘名、“化学名称”、“惯用名”、“化合物名称”或“开发代码”,或若既不使用那些名称之一也不

使用“通用名”，则使用“别名”。“CAS登记号”意指化学文摘登记号。

[0365] 具有式(I)的化合物的活性成分混合物(选自如表1.1至1.7和表2.1和2.7(下表)中表示的一种化合物、或表T1(下文)中列出的化合物1.1至1.112、表T2(下文)中列出的化合物2.1至2.39、表T3(下文)中列出的化合物3.1至3.36、或表T4(下文)中列出的化合物4.1至4.2)优选地是处于从100:1至1:6000的混合比率,尤其是从50:1至1:50,更尤其是处于从20:1至1:20的比率,甚至更尤其是从10:1至1:10,非常尤其是从5:1和1:5,特别优选的是从2:1至1:2的比率,并且从4:1至2:1的比率同样是优选的,特别是处于以下比率1:1、或5:1、或5:2、或5:3、或5:4、或4:1、或4:2、或4:3、或3:1、或3:2、或2:1、或1:5、或2:5、或3:5、或4:5、或1:4、或2:4、或3:4、或1:3、或2:3、或1:2、或1:600、或1:300、或1:150、或1:35、或2:35、或4:35、或1:75、或2:75、或4:75、或1:6000、或1:3000、或1:1500、或1:350、或2:350、或4:350、或1:750、或2:750、或4:750。那些混合比率是按重量计的。

[0366] 如上所述的混合物可以被用于控制有害生物的方法中,该方法包括将含如上所述的混合物的组合物施用于有害生物或其环境中,通过手术或疗法用于处理人或动物体的方法以及在人或动物体上实施的诊断方法除外。

[0367] 包含如表1.1至1.7和表2.1和2.7(下文)中所示的化合物、或表T1(下文)中列出的化合物1.1至1.112、表T2(下文)中列出的化合物2.1至2.39、表T3(下文)中列出的化合物3.1至3.36、或表T4(下文)中列出的化合物4.1至4.2和一种或多种如上所述的活性成分的混合物可以例如以单一的“掺水即用”的形式施用,以组合的喷洒混合物(该混合物由这些单一活性成分的单独配制品构成)(例如“桶混制剂”)施用,并且当以一种顺序的方式(即,一个在另一个适当短的时期之后,例如几小时或几天)施用组合使用这些单独活性成分来施用。施用如表1.1至1.7和表2.1和2.7(下表)中所示的化合物、或表T1(下文)中列出的化合物1.1至1.112、表T2(下文)中列出的化合物2.1至2.39、表T3(下文)中列出的化合物3.1至3.36、或表T4(下文)中列出的化合物4.1至4.2以及一种或多种如上所述的活性成分的顺序对于运作本发明不是必须的。

[0368] 根据本发明的组合物还可以包含另外的固体助剂或液体助剂,如稳定剂,例如未环氧化的或环氧化的植物油(例如环氧化的椰子油、菜籽油或大豆油),消泡剂(例如硅酮油),防腐剂,粘度调节剂,粘合剂和/或增粘剂,肥料或其他用于获得特定效果的活性成分,例如杀细菌剂、杀真菌剂、杀线虫剂、植物活化剂、杀软体动物剂或除草剂。

[0369] 根据本发明的组合物是以本身已知的方式,在不存在助剂的情况下,例如通过研磨、筛选和/或压缩固体活性成分;和在至少一种助剂的存在下,例如通过紧密混合活性成分与一种或多种助剂和/或将活性成分与一种或多种助剂一起研磨来制备。用于制备组合物的这些方法和用于制备这些组合物的化合物(I)的用途也是本发明的主题。

[0370] 本发明的另一方面涉及如本文定义的具有式(I)的化合物或优选的单个化合物、包含如上定义的至少一种具有式(I)的化合物或至少一种优选的单个化合物的组合物、或包含如上定义的至少一种具有式(I)的化合物或至少一种优选的单个化合物的杀真菌或杀昆虫混合物,与如上所述的其他杀真菌剂或杀昆虫剂配混,以用于控制或预防植物(例如有用的植物,如作物植物)、其繁殖材料(例如种子)、收获的作物(例如收获的粮食作物)、或非生命材料被昆虫或被植物病原性微生物、优选真菌生物侵染的用途。

[0371] 本发明的另一方面涉及一种控制或预防植物(例如有用的植物,如作物植物)、其

繁殖材料(例如种子)、收获的作物(例如收获的粮食作物)、或非生命材料被昆虫或被植物病原性微生物或腐败微生物、或可能对有害的生物特别是真菌生物侵染的方法,该方法包括将如上定义的作为活性成分的具有式(I)的化合物或优选的单个化合物施用于植物、植物的部分或其场所、其繁殖材料、或非生命材料的任何部分。

[0372] 控制或预防意指被植物病原性或腐败微生物或对人潜在有害的有机体(尤其是真菌有机体)的侵染减少至这样一个被证明改进的水平。

[0373] 控制或预防植物病原性微生物尤其是真菌生物或昆虫侵染作物植物的、包括施用具有式(I)的化合物或含有至少一种所述化合物的农用化学组合物的优选方法是叶面施用。施用频率和施用比率将取决于受相应的病原体或昆虫侵染的风险。然而,具有式(I)的化合物还可以通过用液体配制品湿透植物的场所或者通过将处于固体形式的化合物例如以颗粒形式施用到土壤(土壤施用)而经由土壤通过根(内吸作用)渗透植物。在水稻作物中,可以将这样的颗粒施用到灌水的稻田中。具有式(I)的化合物也可以通过以下方式施用于种子(包衣):将种子或块茎用杀真菌剂的液体配制品浸渍,或用固体配制品对它们包衣。

[0374] 配制品,例如包含具有式(I)的化合物的组合物以及需要时,用于封装具有式(I)的化合物的固体或液体佐剂或单体,可以按已知的方式制备,通常通过将化合物与增量剂例如溶剂、固体载体和任意的表面活性化合物(表面活性剂)一起紧密混合和/或研磨。

[0375] 有利的施用比率通常是从5g至2kg的活性成分(a. i.)/公顷(ha),优选从10g至1kg a. i./ha,最优选从20g至600g a. i./ha。当作为种子浸泡试剂使用时,适宜的剂量是从10mg至1g活性物质/kg种子。

[0376] 当本发明所述的组合用于处理种子时,比率为0.001至50g具有式(I)的化合物/kg种子、优选从0.01至10g/kg种子,这一般是足够的。

[0377] 适当地,预防性(意指在疾病发展之前)或治愈性(意指疾病发展之后)施用包含根据本发明的具有式(I)的化合物的组合物。

[0378] 本发明的组合物能以任何常规形式使用,例如,以双包装、干种子处理用的粉剂(DS)、种子处理用的乳液(ES)、种子处理用的可流动性浓缩物(FS)、种子处理用的溶液(LS)、种子处理用的水分散性粉剂(WS)、种子处理用的胶囊悬浮液(CF)、种子处理用的凝胶(GF)、乳液浓缩物(EC)、悬浮液浓缩物(SC)、悬浮乳液(SE)、胶囊悬浮液(CS)、水分散性颗粒(WG)、可乳化性颗粒(EG)、油包水型乳液(EO)、水包油型乳液(EW)、微乳液(ME)、分散性油悬剂(OD)、油悬剂(OF)、油溶性液剂(OL)、可溶性浓缩物(SL)、超低容量悬浮剂(SU)、超低容量液剂(UL)、母药(TK)、可分散性浓缩物(DC)、可湿性粉剂(WP)或与农业上可接受的佐剂组合的任何技术上可行的配制品的形式。

[0379] 能以常规方式生产这样的组合物,例如通过混合活性成分与适当的配制惰性剂(稀释剂、溶剂、填充剂及任性地其他配制成分,如表面活性剂、杀生物剂、防冻剂、粘着剂、增稠剂及提供辅佐效果的化合物)。还可以使用意欲长期持续药效的常规缓释配制品。特别地,有待以喷雾形式(如水分散性浓缩物(例如EC、SC、DC、OD、SE、EW、EO等)、可湿性粉剂及颗粒)施用的配制品可以含有表面活性剂(如湿润剂和分散剂)及提供辅佐效果的其他化合物,例如甲醛与萘磺酸盐、烷基芳基磺酸盐、木质素磺酸盐、脂肪烷基硫酸盐及乙氧基化烷基酚和乙氧基化脂肪醇的缩合产物。

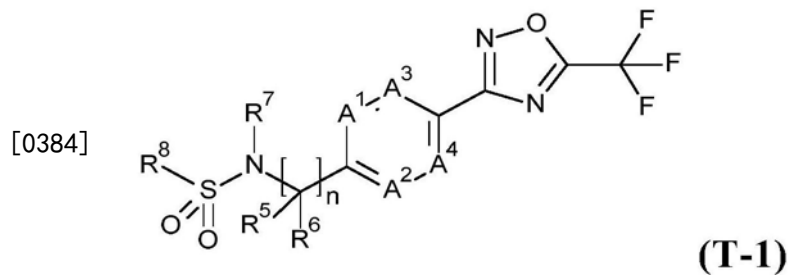
[0380] 使用本发明的组合及稀释剂,以适合的拌种配制品形式,例如具有对种子的良好

粘着性的水性悬浮液或干粉剂形式,用自身已知的方式将拌种配制品施用至种子。这样的拌种配制品在本领域是已知的。拌种配制品可以含有封装形式的单一活性成分或活性成分的组合,例如作为缓释胶囊或微胶囊。

[0381] 通常,所述配制品包括按重量计从0.01%至90%的活性剂、从0至20%的农业上可接受的表面活性剂及10%至99.99%的固体或液体配制惰性剂和一种或多种佐剂,所述活性剂由至少具有式(I)的化合物任选地连同其他活性剂(特别是杀微生物剂或防腐剂等)一起组成。组合物的浓缩形式通常含有按重量计在约2%与80%之间、优选在约5%与70%之间的活性剂。配制品的施用形式可以例如含有按重量计从0.01%至20%、优选按重量计从0.01%至5%的活性剂。然而商业的产品将优选地被配制为浓缩物,最终使用者将通常使用稀释的配制品。

[0382] 然而优选的是将商业的产品配制为浓缩物,最终使用者将通常使用稀释的配制品。

[0383] 表1.1:该表披露了26种具有式(T-1)的特定化合物:



[0385] 其中n是1, A<sup>1</sup>是C-R<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>是C-R<sup>2</sup>, A<sup>3</sup>是C-R<sup>3</sup>, A<sup>4</sup>是C-R<sup>4</sup>并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>是氢, R<sup>7</sup>是甲基并且R<sup>8</sup>是如在下表1中定义的。

[0386] 表1.2至1.7(在表1.1之后)中的每一个使得26种具有式(T-1)的单独化合物可得,其中n、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、A<sup>4</sup>、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>和R<sup>7</sup>是如在表1.2至1.7中具体定义的,这些表引用表1(其中R<sup>8</sup>是具体定义的)。

[0387] 表1

[0388]

化合物 编号	R <sup>8</sup>	化合物 编号	R <sup>8</sup>
1.001	甲基	1.014	环戊基甲基
1.002	乙基	1.015	四氢呋喃-3-基甲基
1.003	丙基	1.016	苯基
1.004	异丙基	1.017	苜基
1.005	正丁基	1.018	4-甲氧基-苯基
1.006	3,3,3-三氟丙基	1.019	2-氟苯基
1.007	2-甲氧基乙基	1.020	2,4-二氟苯基
1.008	1-乙醇酸甲酯	1.021	2,4-二氯苯基甲基
1.009	1-丙酸甲酯	1.022	4-氯-2-氟-苯基甲基
1.010	丙-1-烯基	1.023	5-甲基-噻吩-2-基
1.011	环丙基	1.024	1-甲基-吡唑-3-基
1.012	环丙基甲基	1.025	吡咯烷-1-基
1.013	2,2-二氯环丙基甲基	1.026	吗啉-4-基

[0389] 表1.2: 此表披露了26种具有式(T-1)的特定化合物, 其中n是1, A<sup>1</sup>是C-R<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>是C-R<sup>2</sup>, A<sup>3</sup>是C-R<sup>3</sup>, A<sup>4</sup>是C-R<sup>4</sup>并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>是氢, 并且R<sup>7</sup>是甲氧基, 并且R<sup>8</sup>是如在上表1中定义的。

[0390] 表1.3: 此表披露了26种具有式(T-1)的特定化合物, 其中n是1, A<sup>1</sup>是C-R<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>是C-R<sup>2</sup>, A<sup>3</sup>是C-R<sup>3</sup>, A<sup>4</sup>是C-R<sup>4</sup>并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>是氢, 并且R<sup>7</sup>是乙基, 并且R<sup>8</sup>是如在上表1中定义的。

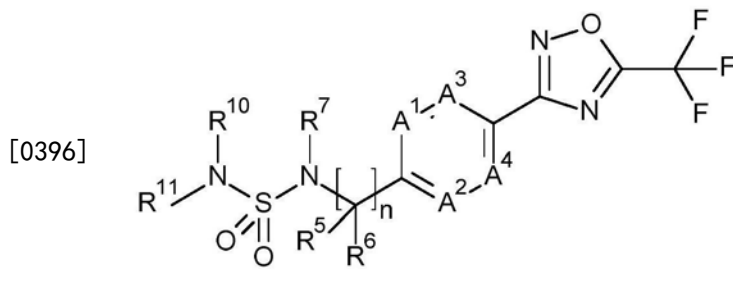
[0391] 表1.4: 此表披露了26种具有式(T-1)的特定化合物, 其中n是1, A<sup>1</sup>是C-R<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>是C-R<sup>2</sup>, A<sup>3</sup>是C-R<sup>3</sup>, A<sup>4</sup>是C-R<sup>4</sup>并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>是氢, 并且R<sup>7</sup>是丙基, 并且R<sup>8</sup>是如在上表1中定义的。

[0392] 表1.5: 此表披露了26种具有式(T-1)的特定化合物, 其中n是1, A<sup>1</sup>是C-R<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>是C-R<sup>2</sup>, A<sup>3</sup>是C-R<sup>3</sup>, A<sup>4</sup>是C-R<sup>4</sup>并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>是氢, 并且R<sup>7</sup>是异丙基, 并且R<sup>8</sup>是如在上表1中定义的。

[0393] 表1.6: 此表披露了26种具有式(T-1)的特定化合物, 其中n是1, A<sup>1</sup>是C-R<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>是C-R<sup>2</sup>, A<sup>3</sup>是C-R<sup>3</sup>, A<sup>4</sup>是C-R<sup>4</sup>并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>是氢, 并且R<sup>7</sup>是环丙基, 并且R<sup>8</sup>是如在上表1中定义的。

[0394] 表1.7: 此表披露了26种具有式(T-1)的特定化合物, 其中n是1, A<sup>1</sup>是C-R<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>是C-R<sup>2</sup>, A<sup>3</sup>是C-R<sup>3</sup>, A<sup>4</sup>是C-R<sup>4</sup>并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>和R<sup>7</sup>是氢, 并且R<sup>8</sup>是如在上表1中定义的。

[0395] 表2.1:此表披露了6种具体的具有式(T-2)的化合物:



[0397] 其中n是1, A<sup>1</sup>是C-R<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>是C-R<sup>2</sup>, A<sup>3</sup>是C-R<sup>3</sup>, A<sup>4</sup>是C-R<sup>4</sup>并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>是氢, R<sup>7</sup>是甲基并且R<sup>8</sup>是如在下表2中定义的。

[0398] 表2.2至2.7(在表2.1之后)中的每一个使得6种具有式(T-2)的单独化合物可得, 其中n、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、A<sup>4</sup>、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>和R<sup>7</sup>是如在上表2.2至2.7中具体定义的, 这些表引用表2(其中-N(R<sup>10</sup>)R<sup>11</sup>是具体定义的)。

[0399] 表2

[0400]

化合物编号	-N(R <sup>10</sup> )R <sup>11</sup>	化合物编号	-N(R <sup>10</sup> )R <sup>11</sup>
2.001	N-甲基氨基	2.004	N-环丙基氨基
2.002	N-乙基氨基	2.005	N-丙-2-炔基氨基
2.003	N-丙基氨基	2.006	N,N-二甲基氨基

[0401] 表2.2:此表披露了6种具有式(T-2)的特定化合物, 其中n是1, A<sup>1</sup>是C-R<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>是C-R<sup>2</sup>, A<sup>3</sup>是C-R<sup>3</sup>, A<sup>4</sup>是C-R<sup>4</sup>并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>是氢, 并且R<sup>7</sup>是甲氧基, 并且-N(R<sup>10</sup>)R<sup>11</sup>是如在上表2中定义的。

[0402] 表2.3:此表披露了6种具有式(T-2)的特定化合物, 其中n是1, A<sup>1</sup>是C-R<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>是C-R<sup>2</sup>, A<sup>3</sup>是C-R<sup>3</sup>, A<sup>4</sup>是C-R<sup>4</sup>并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>是氢, 并且R<sup>7</sup>是乙基, 并且-N(R<sup>10</sup>)R<sup>11</sup>是如在上表2中定义的。

[0403] 表2.4:此表披露了6种具有式(T-2)的特定化合物, 其中n是1, A<sup>1</sup>是C-R<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>是C-R<sup>2</sup>, A<sup>3</sup>是C-R<sup>3</sup>, A<sup>4</sup>是C-R<sup>4</sup>并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>是氢, 并且R<sup>7</sup>是丙基, 并且-N(R<sup>10</sup>)R<sup>11</sup>是如在上表2中定义的。

[0404] 表2.5:此表披露了6种具有式(T-2)的特定化合物, 其中n是1, A<sup>1</sup>是C-R<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>是C-R<sup>2</sup>, A<sup>3</sup>是C-R<sup>3</sup>, A<sup>4</sup>是C-R<sup>4</sup>并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>是氢, 并且R<sup>7</sup>是异丙基, 并且-N(R<sup>10</sup>)R<sup>11</sup>是如在上表2中定义的。

[0405] 表2.6:此表披露了6种具有式(T-2)的特定化合物, 其中n是1, A<sup>1</sup>是C-R<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>是C-R<sup>2</sup>, A<sup>3</sup>是C-R<sup>3</sup>, A<sup>4</sup>是C-R<sup>4</sup>并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>是氢, 并且R<sup>7</sup>是环丙基, 并且-N(R<sup>10</sup>)R<sup>11</sup>是如在上表2中定义的。

[0406] 表2.7:此表披露了6种具有式(T-2)的特定化合物, 其中n是1, A<sup>1</sup>是C-R<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>是C-R<sup>2</sup>, A<sup>3</sup>是C-R<sup>3</sup>, A<sup>4</sup>是C-R<sup>4</sup>并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>和R<sup>7</sup>是氢, 并且-N(R<sup>10</sup>)R<sup>11</sup>是如在上表2中定义的。

[0407] 实例

[0408] 接下来的实例用来阐明本发明。本发明的化合物与已知的化合物的区别可以在于在低施用率下更大的疗效, 这可以由本领域的技术人员使用在实例中概述的实验程序, 使



用更低的施用率(如果必要的话)例如,50ppm、12.5ppm、6ppm、3ppm、1.5ppm、0.8ppm或0.2ppm来证实。

[0409] 具有式(I)的化合物可以具有任何数量的益处,尤其包括针对保护植物免受由真菌引起的疾病的有利水平的生物活性或对于用作农用化学品活性成分的优越特性(例如,更高的生物活性、有利的活性谱、增加的安全性(包括改善的作物耐受性)、改进的物理-化学特性、或增加的生物可降解性)。

[0410] 贯穿本说明书,以摄氏度(°C)给出温度并且“mp”意指熔点。LC/MS意指液相色谱-质谱,并且装置和方法(方法A、B和C)的描述如下:

[0411] LC/MS装置和方法A的描述是:

[0412] 来自沃特斯公司(Waters)的SQ检测器2

[0413] 离子化方法:电喷雾

[0414] 极性:正离子和负离子

[0415] 毛细管(kV)3.0,锥孔(V)30.00,提取器(V)2.00,源温度(°C)150,去溶剂化温度(°C)350,锥孔气体流量(L/Hr)0,去溶剂化气体流量(L/Hr)650

[0416] 质量范围:100至900Da

[0417] DAD波长范围(nm):210至500

[0418] 方法用以下HPLC梯度条件的沃特斯ACQUITY UPLC

[0419] (溶剂A:水/甲醇20:1+0.05%甲酸以及溶剂B:乙腈+0.05%甲酸)

	时间(分钟)	A(%)	B(%)	流速(ml/min)
[0420]	0	100	0	0.85
	1.2	0	100	0.85
	1.5	0	100	0.85

[0421] 柱类型:沃特斯公司的ACQUITY UPLC HSS T3;柱长:30mm;柱内径:2.1mm;粒度:1.8微米;温度:60°C。

[0422] LC/MS装置和方法B的描述是:

[0423] 来自沃特斯公司的SQ检测器2

[0424] 离子化方法:电喷雾

[0425] 极性:正离子

[0426] 毛细管(kV)3.5,锥孔(V)30.00,提取器(V)3.00,源温度(°C)150,去溶剂化温度(°C)400,锥孔气体流量(L/Hr)60,去溶剂化气体流量(L/Hr)700

[0427] 质量范围:140至800Da

[0428] DAD波长范围(nm):210至400

[0429] 方法:用以下HPLC梯度条件的沃特斯公司的ACQUITY UPLC

[0430] (溶剂A:水/甲醇9:1+0.1%甲酸以及溶剂B:乙腈+0.1%甲酸)

	时间 (分钟)	A (%)	B (%)	流速 (ml/min)
	<b>0</b>	<b>100</b>	<b>0</b>	<b>0.75</b>
[0431]	<b>2.5</b>	<b>0</b>	<b>100</b>	<b>0.75</b>
	<b>2.8</b>	<b>0</b>	<b>100</b>	<b>0.75</b>
	<b>3.0</b>	<b>100</b>	<b>0</b>	<b>0.75</b>

[0432] 柱类型:沃特斯公司的ACQUITY UPLC HSS T3;柱长:30mm;柱内径:2.1mm;粒度:1.8微米;温度:60℃。

[0433] LC/MS装置和方法C的描述是:

[0434] 来自沃特斯公司的SQ检测器2

[0435] 离子化方法:电喷雾

[0436] 来自沃特斯公司的质谱仪ACQUITY H级UPLC

[0437] 极性:正和负极性转换

[0438] 扫描类型:MS1扫描

[0439] 毛细管(kV) 3.00, 锥孔(V) 40.00, 去溶剂化温度(℃) 500, 锥孔气体流量(L/Hr) 50, 去溶剂化气体流量(L/Hr) 1000

[0440] 质量范围:0至2000Da

[0441] DAD波长范围(nm):200至350

[0442] 方法:用以下HPLC梯度条件的沃特斯公司的ACQUITY UPLC

[0443] (溶剂A:水+0.1%甲酸,和溶剂B:乙腈)

	时间(分钟)	A (%)	B (%)	流速 (ml/min)
	<b>0</b>	<b>70</b>	<b>30</b>	<b>0.5</b>
	<b>0.05</b>	<b>70</b>	<b>30</b>	<b>0.5</b>
[0444]	<b>0.8</b>	<b>5</b>	<b>95</b>	<b>0.5</b>
	<b>1.8</b>	<b>5</b>	<b>95</b>	<b>0.5</b>
	<b>2.45</b>	<b>70</b>	<b>30</b>	<b>0.5</b>
	<b>2.50</b>	<b>70</b>	<b>30</b>	<b>0.5</b>

[0445] 柱类型:沃特斯公司的ACQUITY UPLC BEH C18;柱长:50mm;柱内径:2.1mm;粒度:1.7微米;温度:35℃。

[0446] LC/MS装置和方法D的描述是:

[0447] 质谱仪:来自赛默飞公司(Thermo)的MSQ单四极杆

[0448] HPLC:来自赛默飞公司的Surveyor系列HPLC

[0449] 离子化方法:大气压化学电离(APCI)

[0450] 极性:正和负极性转换

[0451] 扫描类型:MS全扫描

[0452] 锥孔电压(V):50.00;探头温度(℃):400;Corona sid:50探测器(V):1400

[0453] 质量范围:50至700Da扫描时间(秒):0.3

[0454] 梯度条件:溶剂A:含0.1%甲酸的水,溶剂B:甲醇

	时间(分钟)	A(%)	B(%)	流速(ml/min)
[0455]	0	90	10	1.7
	0.5	90	10	1.7
	1.5	0	100	1.7
[0456]	4.0	0	100	1.7
	5.0	90	10	1.7
	5.5	90	10	1.7

[0457] 柱类型:沃特斯公司的XTERRA C18;柱长:30mm;柱内径:4.6mm;粒度:3.5 $\mu$ ;UV范围(nm):210-350

[0458] 在必要时,在对映异构体意义上纯的最终化合物可以在适当时候从外消旋材料经由标准物理分离技术(例如反相手性色谱)或通过立体选择性合成技术(例如通过使用手性起始材料)获得。

[0459] 配制品实例

	<u>可湿性粉剂</u>	a)	b)	c)
	活性成分 [具有式 (I) 的化合物]	25%	50%	75%
	木质素磺酸钠	5%	5%	-
	月桂基硫酸钠	3%	-	5%
[0460]	二异丁基萘磺酸钠	-	6%	10%
	苯酚聚乙二醇醚 (7-8 mol 的环氧乙烷)	-	2%	-
	高度分散的硅酸	5%	10%	10%
	高岭土	62%	27%	-

[0461] 将该活性成分与这些佐剂充分混合并且将混合物在适合的研磨机中充分研磨,从而提供可以用水稀释而给出所希望的浓度的悬浮液的可湿性粉剂。

[0462] 干种子处理用的粉剂

	a)	b)	c)
--	----	----	----

	<b>活性成分 [具有式 (I) 的化合物]</b>	<b>25%</b>	<b>50%</b>	<b>75%</b>
	<b>轻质矿物油</b>	<b>5%</b>	<b>5%</b>	<b>5%</b>
[0463]	<b>高度分散的硅酸</b>	<b>5%</b>	<b>5%</b>	<b>-</b>
	<b>高岭土</b>	<b>65%</b>	<b>40%</b>	<b>-</b>
	<b>滑石</b>	<b>-</b>		<b>20%</b>

[0464] 将该活性成分与这些佐剂充分混合并且将混合物在适当的研磨机中充分研磨,从而提供可以直接用于种子处理的粉末。

[0465] 可乳化浓缩物

	<b>活性成分 [具有式 (I) 的化合物]</b>	<b>10%</b>
	<b>辛基酚聚乙二醇醚</b>	<b>3%</b>
	<b>(4-5 mol 的环氧乙烷)</b>	
[0466]	<b>十二烷基苯磺酸钙</b>	<b>3%</b>
	<b>蓖麻油聚乙二醇醚 (35 mol 的环氧乙烷)</b>	<b>4%</b>
	<b>环己酮</b>	<b>30%</b>
	<b>二甲苯混合物</b>	<b>50%</b>

[0467] 在植物保护中可以使用的具有任何所要求的稀释的乳液可以通过用水稀释从这种浓缩物中获得。

	<b>尘剂</b>	<b>a)</b>	<b>b)</b>	<b>c)</b>
	<b>活性成分 [具有式 (I) 的化合物]</b>	<b>5%</b>	<b>6%</b>	<b>4%</b>
[0468]	<b>滑石</b>	<b>95%</b>	<b>-</b>	<b>-</b>
	<b>高岭土</b>	<b>-</b>	<b>94%</b>	<b>-</b>
	<b>矿物填料</b>	<b>-</b>	<b>-</b>	<b>96%</b>

[0469] 通过将该活性成分与载体混合并且将混合物在适合的研磨机中研磨而获得即用型尘剂。此类粉剂还可以用于种子的干拌种。

[0470] 挤出机颗粒

	<b>活性成分 [具有式 (I) 的化合物]</b>	<b>15%</b>
	<b>木质素磺酸钠</b>	<b>2%</b>
[0471]	<b>羧甲基纤维素</b>	<b>1%</b>
	<b>高岭土</b>	<b>82%</b>

[0472] 将该活性成分与这些佐剂混合并且研磨,并且将该混合物用水润湿。将混合物挤出并且然后在空气流中干燥。

[0473] 包衣颗粒剂

[0474] 活性成分 [具有式 (I) 的化合物] 8%

[0475] 聚乙二醇 (分子量200) 3%

[0476] 高岭土 89%

[0477] 将精细研磨的活性成分在混合器中均匀地施用到用聚乙二醇湿润的高岭土上。以该方式获得非尘的包衣颗粒剂。

[0478] 悬浮液浓缩物

**活性成分 [具有式 (I) 的化合物] 40%**

**丙二醇 10%**

**壬基酚聚乙二醇醚 (15 mol 的环氧乙烷) 6%**

[0479] **木质素磺酸钠 10%**

**羧甲基纤维素 1%**

**硅酮油 (处于在水中 75% 的乳液的形式) 1%**

**水 32%**

[0480] 将精细研磨的活性成分与佐剂紧密地混合,得到悬浮液浓缩物,从该悬浮液浓缩液可以通过用水稀释获得任何所希望的稀释度的悬浮液。使用此类稀释物,可以对活的植物连同植物繁殖材料进行处理并且对其针对微生物侵染通过喷雾、浇灌或浸渍进行保护。

[0481] 种子处理用的可流动性浓缩物

**活性成分 [具有式 (I) 的化合物] 40%**

**丙二醇 5%**

**共聚物丁醇 PO/EO 2%**

**三苯乙烯酚, 具有 10-20 摩尔 EO 2%**

[0482] **1,2-苯并异噻唑啉-3-酮(处于在水中 20% 的溶液形式) 0.5%**

**单偶氮-颜料钙盐 5%**

**硅酮油 (处于在水中 75% 的乳液的形式) 0.2%**

**水 45.3%**

[0483] 将精细研磨的活性成分与佐剂紧密地混合,得到悬浮液浓缩物,从该悬浮液浓缩液可以通过用水稀释获得任何所希望的稀释度的悬浮液。使用此类稀释物,可以对活的植物连同植物繁殖材料进行处理并且对其针对微生物侵染通过喷雾、浇灌或浸渍进行保护。

[0484] 缓释的胶囊悬浮液

[0485] 将28份的具有式 (I) 的化合物的组合与2份的芳香族溶剂以及7份的甲苯二异氰酸酯/多亚甲基-聚苯基异氰酸酯-混合物 (8:1) 进行混合。将该混合物在1.2份的聚乙烯醇、

0.05份的消泡剂以及51.6份的水的混合物中进行乳化直至达到所希望的粒度。向该乳液中添加在5.3份的水中的2.8份的1,6-己二胺混合物。将混合物搅拌直至聚合反应完成。

[0486] 将获得的胶囊悬浮液通过添加0.25份的增稠剂以及3份的分散剂进行稳定。该胶囊悬浮液配制品含有28%的活性成分。中等胶囊的直径是8-15微米。

[0487] 将所得配制品作为适用于此目的装置中的水性悬浮液施用到种子上。

[0488] 缩写清单:

[0489] AIBN=偶氮二异丁腈

[0490] brs=宽单峰

[0491] DCM=二氯甲烷

[0492] DIBAL-H=二异丁基氢化铝

[0493] DIPEA=N,N-二异丙基乙基胺

[0494] DMF=二甲基甲酰胺

[0495] EtOAc=乙酸乙酯

[0496] EtOH=乙醇

[0497] HCl=盐酸

[0498] mp=熔点

[0499] MeOH=甲醇

[0500] N=正常

[0501] NaH=氢化钠

[0502] NaOH=氢氧化钠

[0503] NBS=N-溴代琥珀酰亚胺

[0504] RT=室温

[0505] TBME=叔丁基甲醚

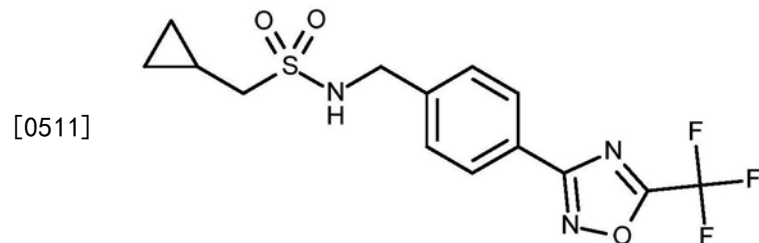
[0506] TFAA=三氟乙酸酐

[0507] THF=四氢呋喃

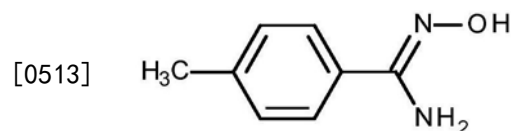
[0508] 制备实例

[0509] 相应地可以使用上述以及下述的合成技术制备具有式(I)的化合物。

[0510] 实例1:该实例说明1-环丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺(化合物3.3表T3)的制备

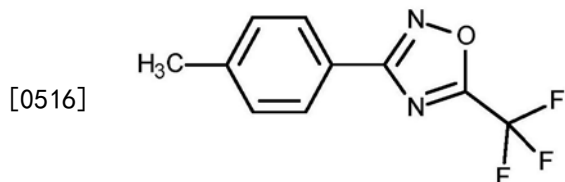


[0512] 步骤1:4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰氯的制备



[0514] 在室温下向乙醇(220mL)和水(440mL)中的4-甲基苯甲脒(35g,0.29mol)的搅拌悬浮液中添加羟胺盐酸盐(41.1g,0.58mol)、碳酸钾(65.4g,0.47mol)和8-羟基喹啉(0.22g,1.5mmol)。将反应混合物在80℃下加热4小时。将混合物冷却至室温并用2N HCl稀释至pH 8。在减压下蒸发乙醇。将混合物过滤,用水洗涤并在真空下干燥,以提供39.1g标题化合物。LC/MS(方法A)保留时间=0.23分钟,151.0(M+H)。

[0515] 步骤2:3-(对甲苯基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑的制备



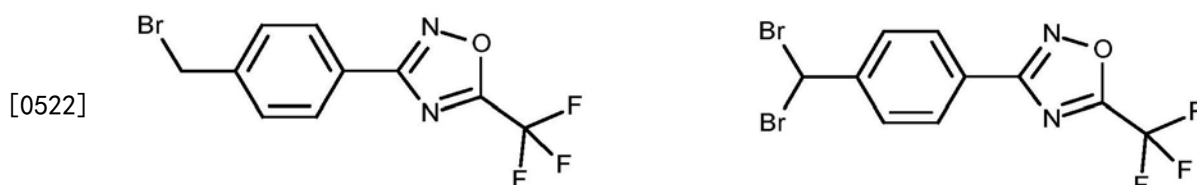
[0517] 在0℃向N'-羟基-4-甲基-苯甲脒(38.7g,0.25mol)在2-甲基四氢呋喃(750mL)中的搅拌溶液中添加TFAA。将反应混合物在15℃下搅拌两小时,并用水稀释。将有机层分离,依次用碳酸氢钠溶液、氯化铵溶液和水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并蒸发至干燥。将粗品在硅胶(750g预填充柱)上用庚烷/EtOAc 99:1至90:10进行快速色谱,以提供54.1g呈澄清油状物的标题化合物,其在储存后固化。

[0518] LC/MS(方法A)保留时间=1.15分钟,未检测到质量。

[0519]  $^1\text{H}$  NMR(400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm:8.00(d,2H),7.32(d,2H),2.45(s,3H)。

[0520]  $^{19}\text{F}$  NMR(400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm:-65.41(s)。

[0521] 步骤3a:3-[4-(溴甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑的制备



[0523] 在氩气下,将3-(对甲苯基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(56.0g,0.24mol)和NBS(45.4g,0.25mol)在四氯甲烷(480mL)中的搅拌混合物加热至70℃。添加AIBN(4.03g,24mmol),并将反应混合物在65℃下搅拌18小时。将混合物冷却至室温并用二氯甲烷和水稀释。将各层分离。将有机层用碳酸氢钠溶液洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并蒸发至干燥。将粗品在硅胶(750g预填充柱)上用环己烷/EtOAc 100:0至95:5进行快速色谱,以提供44.7g呈白色固体的标题化合物,mp:58℃-63℃。

[0524]  $^1\text{H}$  NMR(400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm:8.11(d,2H),7.55(d,2H),4.53(s,2H)。

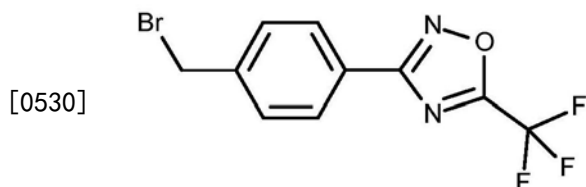
[0525]  $^{19}\text{F}$  NMR(400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm:-65.32(s)。

[0526] 3-[4-(二溴甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑被分离为呈白色固体的副产物,mp:61℃-66℃。

[0527]  $^1\text{H}$  NMR(400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm:8.15(d,2H),7.73(d,2H),6.68(s,1H)。

[0528]  $^{19}\text{F}$  NMR(400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm:-65.34(s)。

[0529] 步骤3b:从3-[4-(二溴甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑制备3-[4-(溴甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑

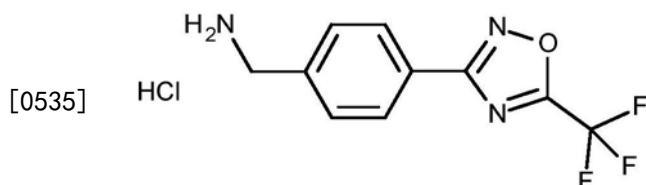


[0531] 在5℃下,向乙腈(95mL)、水(1.9mL)和DIPEA(6.20ml,35.7mmol)中的3-[4-(溴甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑和3-[4-(二溴甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(10.2g)的1:9比例混合物中添加亚磷酸二乙酯(4.7ml,35.7mmol)。将混合物在5℃-10℃下搅拌两小时,添加水和1M HCl,并且将乙腈在减压下蒸发。将白色浆液用二氯甲烷萃取三次。将合并的有机层经硫酸钠干燥,并且过滤。将溶剂在减压下除去,并且将所得粗品在硅胶(40g预填充柱)上用环己烷/EtOAc 99:1至9:1进行快速色谱,以提供7.10g的3-[4-(溴甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑。

[0532]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: 8.11 (d, 2H), 7.55 (d, 2H), 4.53 (s, 2H)。

[0533]  $^{19}\text{F}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: -65.32 (s)。

[0534] 步骤4: [4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲胺盐酸盐的制备



[0536] 在氩气下将配备有搅拌器的干燥烧瓶用氢氧化钠(2当量,3.13mmol,60质量%NaH)和四氢呋喃(25mL)装填。向此白色悬浮液中添加N-叔丁氧基羰基氨基甲酸叔丁酯(1.1当量,1.72mmol),并且在搅拌5min时观察到气体逸出。然后引入3-[4-(溴甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(0.500g,1.56mmol),并且将内容物搅拌12小时。在反应完成时,将溶液倒入水中并用乙酸乙酯(2x 30mL)萃取。将有机层合并并经硫酸钠干燥,过滤,并在减压下浓缩,以产生淡黄色油状物,其在沉落后部分结晶。将黄色材料溶于二噁烷(5mL)中,并在二噁烷中逐滴引入4M氯化氢(15当量,24.7mmol)。在22℃下搅拌过夜之后,将反应溶液用醚稀释,并提供白色沉淀物(70%产率),对沉淀物的分析与报告值匹配,并将所述沉淀物不经进一步纯化而使用。

[0537] mp: >200℃。

[0538] LC/MS (方法A) 保留时间=0.61分钟,244 (M+H)。

[0539]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$ ppm: 8.56 (brs, 2H), 8.13 (d, 2H), 7.75 (d, 2H), 4.15 (s, 2H)。

[0540]  $^{19}\text{F}$  NMR (400MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$ ppm: -64.69 (s)。

[0541] 可替代地,标题化合物可以使用如WO 2013/066839中描述的类似程序制备。

[0542] 在70℃下向N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]-氨基甲酸叔丁酯(23.1g,65.4mmol)在1,4-二噁烷(196mL)中的搅拌溶液中滴加4M HCl的1,4-二噁烷(41mL,163mmol)溶液。白色固体的沉淀和气体逸出在添加后5分钟开始。将混合物在70℃下搅拌6小时。将白色悬浮液冷却低至23℃,经烧结件4号漏斗过滤,用1,4-二噁烷洗涤,并且在减压下在40℃干燥,以产生17.3g呈黄色固体的[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]



苯基]甲胺盐酸盐。

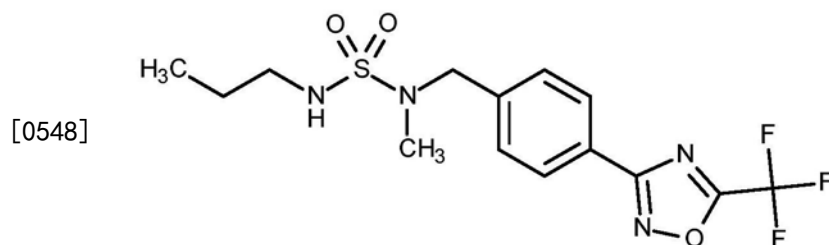
[0543] 步骤5:1-环丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺的制备

[0544] 用三乙胺(0.08mL,0.53mmol)处理[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲胺盐酸盐(50mg,0.18mmol)和DCM(1.8mL)的澄清溶液,然后用环丙基甲磺酰氯(35mg,0.51mmol)处理。2小时后,将 **Isolute®** 吸附剂添加到反应混合物中并且将挥发物在减压下除去。将粗产物在硅胶上用环己烷/EtOAc 99:1至1:1进行快速色谱,以提供呈无色油状物的标题化合物(47mg,73%产率)。LC/MS(方法A)保留时间=1.05分钟,360(M-H)。

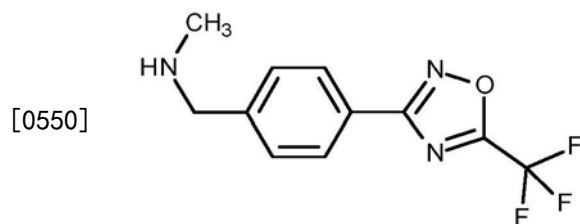
[0545]  $^1\text{H}$  NMR(400MHz, $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ :8.21(d,2H),7.52(d,2H),4.60(m,1H),4.40(d,2H),2.94(d,2H),1.53(s,3H),1.25(m,1H),0.70(q,2H),0.38(q,2H)。

[0546]  $^{19}\text{F}$  NMR(400MHz, $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ :-65.35(s)。

[0547] 实例2:该实例说明3-[4-[[甲基(丙基氨磺酰基)氨基]甲基]苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(化合物1.23表T1)的制备



[0549] 步骤1:N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲胺的制备



[0551] 在室温下逐滴添加3-[4-(溴甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(15g,46.9mmol)在THF(20mL)中的溶液至甲胺2M在THF中的溶液(120mL,234.5mmol)。将混合物在室温下搅拌24小时。将溶剂在减压下除去,并且将所得粗材料在硅胶(环己烷/EtOAc洗脱液梯度1:0至1:1)上通过快速色谱纯化,以得到10.3g呈澄清油状物的标题化合物。LC/MS(方法A)保留时间=0.58分钟,258(M+H)。

[0552]  $^1\text{H}$  NMR(400MHz, $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ :8.08(d,2H),7.47(d,2H),3.84(s,2H),2.48(s,3H)。

[0553]  $^{19}\text{F}$  NMR(400MHz, $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ :-65.39(s)。

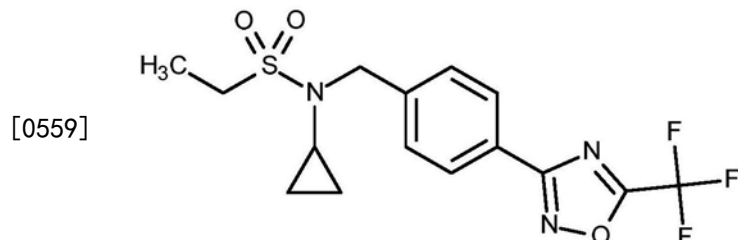
[0554] 步骤2:3-[4-[[甲基(丙基氨磺酰基)氨基]甲基]苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑的制备

[0555] 将[N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲胺(0.5mg,1.94mmol)和二氯甲烷(5.8mL)的澄清溶液用三乙胺(0.82mL,5.8mmol)处理,然后用N-丙基氨磺酰氯(1.5g,9.7mmol)处理。搅拌过夜后,添加水,并且用二氯甲烷萃取有机物。将粗产物在硅胶上用环己烷/EtOAc 99:1至1:1进行快速色谱,以提供呈无色油状物的标题化合物(0.02g,2%产率)。

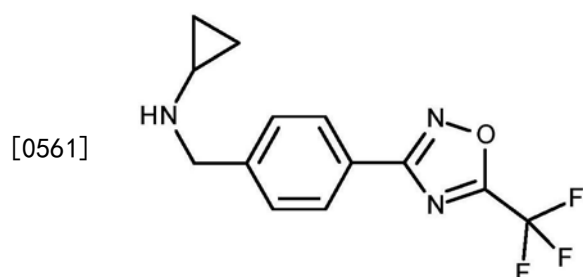
[0556]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ : 8.04 (d, 2H), 7.59 (d, 2H), 4.43 (s, 2H), 4.40 (d, 2H), 2.82 (q, 2H), 2.37 (m, 2H), 1.45 (q, 2H), 0.87 (t, 3H)。

[0557]  $^{19}\text{F}$  NMR (400MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ : -64.71 (s)。

[0558] 实例3: 该实例说明了N-环丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙烷磺酰胺(化合物1.1表T1)的制备



[0560] 步骤1: N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]环丙胺的制备



[0562] 在室温下,经2小时内将3-[4-(溴甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(2.50g, 8.1mmol)在二氯甲烷(5mL)中的溶液添加至环丙胺(3.7g, 65mmol)和N-乙基-N-异丙基-丙-2-胺(1.4mL, 8.1mmol)在二氯甲烷(10mL)中的溶液中。将混合物在室温下搅拌30分钟,倒入水中,并且然后用二氯甲烷萃取。将合并的有机层用盐水洗涤,经硫酸钠干燥并过滤。将溶剂在减压下除去,并且将所得粗残余物在硅胶(环己烷/EtOAc洗脱液梯度1:0至1:1)上通过快速色谱纯化,以得到1.18g呈白色固体的标题化合物,LC/MS(方法A)保留时间=0.71分钟,300 (M+H)。

[0563]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ : 8.06 (d, 2H), 7.49 (d, 2H), 3.92 (s, 2H), 2.18 (m, 1H), 1.85 (brs, 1H), 0.42 (m, 2H), 0.39 (m, 2H)。

[0564]  $^{19}\text{F}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ : -65.36 (s)。

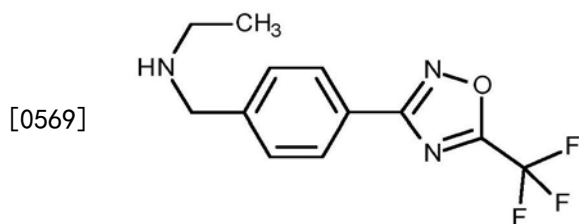
[0565] 步骤2: N-环丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙烷磺酰胺的制备

[0566] 在0℃下在N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]环丙胺(0.20g, 0.7mmol)和DCM(2mL)的溶液中引入三乙胺(0.2g, 2.0mmol),并且在10分钟后引入乙磺酰氯(0.1g, 0.8mmol)。4小时后,添加水,并且用二氯甲烷萃取有机物。将总的合并的有机级分用水和盐水洗涤,然后减压浓缩。将粗产物经受硅胶快速色谱(用环己烷/EtOAc 80:20至1:1),得到呈白色固体的3-[4-[[环丙基(乙基氨磺酰基)氨基]甲基]苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(0.16g, 60%产率)。mp. 108℃-110℃。

[0567]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ : 8.11 (d, 2H), 7.58 (d, 2H), 4.53 (s, 2H), 3.05 (q, 2H), 2.45 (m, 1H), 1.58 (m, 1H), 1.37 (m, 3H), 0.80 (m, 4H)。

[0568] 实例4: 此实例说明了中间体N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲

基]乙胺的制备



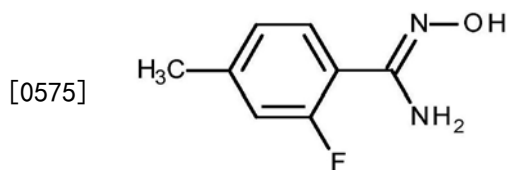
[0570] 在室温下将二氯甲烷(9.4mL)中的3-[4-(溴甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(1.50g, 4.69mmol)的溶液逐滴添加到MeOH中的乙胺2M的搅拌溶液(12mL, 24.0mmol)中。将混合物在室温下搅拌24小时。将反应混合物倒入水中并分离各层。将水层用二氯甲烷萃取三次。将合并的有机层用盐水洗涤,经硫酸钠干燥并过滤。将溶剂在减压下除去,并且将所得粗品在硅胶(环己烷:EtOAc洗脱液梯度1:0至1:1)上通过快速色谱纯化,以得到0.92g呈白色固体的标题化合物,mp:102°C-112°C,LC/MS(方法A)保留时间=0.66分钟,272(M+H)。

[0571]  $^1\text{H}$  NMR(400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ : 8.01(d, 2H), 7.57(d, 2H), 3.86(q, 2H), 3.29(brs, 1H), 2.53(q, 2H), 1.05(t, 3H)。

[0572]  $^{19}\text{F}$  NMR(400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ : -64.77(s)。

[0573] 实例5: 该实例说明了中间体1-[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]-N-甲氧基-甲胺的制备

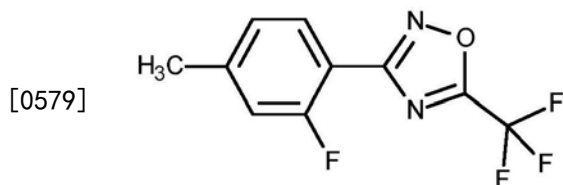
[0574] 步骤1: 2-氟-N'-羟基-4-甲基-苯甲脒的制备



[0576] 在25°C下向2-氟-4-甲基苯甲脒(5g, 37.0mmol)在乙醇(125mL)中的悬浮液中添加羟胺盐酸盐(7.7g, 111mmol)。将反应混合物在80°C下加热2小时。冷却至室温后,将挥发物在减压下除去,由此提供白色固体(其不经任何纯化而用于下一步)。LC/MS(方法A)保留时间=1.14分钟,169.2(M+H)。

[0577]  $^1\text{H}$  NMR(400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ : 7.96(t, 1H), 7.11(m, 2H), 2.45(s, 3H)。

[0578] 步骤2: 3-(2-氟-4-甲基-苯基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑的制备

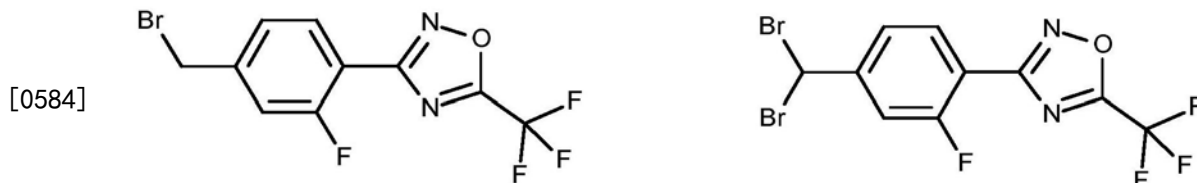


[0580] 向经由冰浴冷却的四氢呋喃(122mL)中的2-氟-N'-羟基-4-甲基-苯甲脒(37mmol)的溶液中添加TFAA(7.71mL, 55.5mmol)。将反应混合物在25°C搅拌过夜并且然后用水稀释。将有机层分离,依次用碳酸氢钠溶液、氯化铵溶液和水洗涤,然后经硫酸钠干燥,过滤并蒸发至干燥。将粗产物在硅胶上用环己烷/EtOAc 99:1至1:1进行快速色谱,以提供呈无定形白色固体的标题化合物(6.6g, 72%产率)LC/MS(方法A)保留时间=1.14分钟,247(M+H)。

[0581]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: 8.00 (d, 1H), 7.32 (d, 2H), 2.45 (s, 3H)。

[0582]  $^{19}\text{F}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: -65.3 (s), 108.1 (s)。

[0583] 步骤3a: 3-[4-(溴甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑的制备



[0585] 在氩气下将3-(2-氟-4-甲基-苯基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑 (4.2g, 17.1mmol) 和NBS (3.11g, 17.1mmol) 在四氯甲烷 (34.3mL) 中的搅拌混合物加热至70℃。添加AIBN (0.29g, 1.71mmol), 并且将反应混合物在65℃下搅拌18小时。将混合物冷却至25℃, 然后用二氯甲烷和水稀释, 之后分离各层。将琥珀酰亚胺副产物滤掉, 并且将溶剂在减压下除去, 以提供棕色胶状物。将此粗残余物在硅胶上用环己烷/EtOAc 100:0至4:1进行快速色谱, 以提供呈白色固体的标题化合物 (1.7g, 31%产率)。LC/MS (方法A) 停留时间=1.13分钟, (M+H) 未检测到。

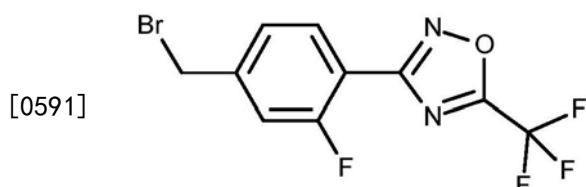
[0586]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: 8.09 (t, 1H), 7.34 (m, 2H), 4.49 (s, 2H)。

[0587]  $^{19}\text{F}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: -65.18 (s), -106.2 (s)。

[0588] 将3-[4-(二溴甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑分离为呈米色固体形式的副产物 (4.0g, 58%产率) (LC/MS (方法A) 保留时间=1.20分钟, 未检测 (M+H))。

[0589]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: 8.14 (d, 1H), 7.52 (dd, 2H), 6.63 (s, 1H)。

[0590] 步骤3b: 由33-[4-(二溴甲基)-2-氟-苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑制备3-[4-(溴甲基)-2-氟-苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑



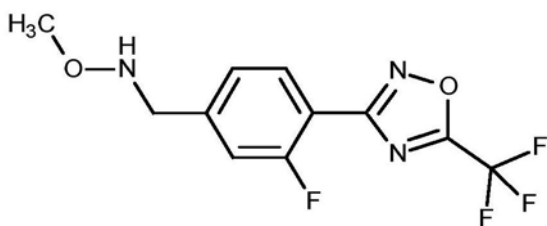
[0592] 在5℃下向乙腈 (37mL)、水 (0.8mL) 和DIPEA (2.59mL, 14.8mmol) 中的3-[4-(溴甲基)-2-氟-苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑和3-[4-(二溴甲基)-2-氟-苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑 (4.0g, 9.9mmol) 的1:20比例混合物中添加亚磷酸二乙酯 (2.0mL, 14.8mmol)。将混合物在5℃-10℃下搅拌2小时, 添加水和1M HCl, 并且将挥发物在减压下除去。将白色浆液用二氯甲烷萃取三次, 并且将合并的有机层经硫酸钠干燥并过滤。将溶剂在减压下除去, 并且使所得浅橙色粗残余物在硅胶上用环己烷/EtOAc 99:1至1:1进行快速色谱, 以提供3-[4-(溴甲基)-2-氟-苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑 (2.2g, 68%产率)。LC/MS (方法A) 停留时间=1.13分钟, (M+H) 未检测到。

[0593]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: 8.09 (t, 1H), 7.34 (m, 2H), 4.49 (s, 2H)。

[0594]  $^{19}\text{F}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: -65.18 (s), -106.2 (s)。

[0595] 步骤4: 1-[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]-N-甲氧基-甲胺的制备

[0596]



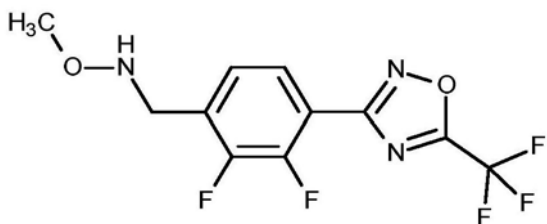
[0597] 将二氯甲烷 (15mL) 中的 *N*-甲氧基羟胺盐酸盐 (4.9g, 59mmol) 的溶液用 DIPEA (12mL, 66mmol) 逐滴处理, 随后用二氯甲烷 (5mL) 中的 3-[4-(溴甲基)-2-氟苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑 (1.2g, 3.7mmol) 的溶液处理。18h 后, 引入水 (10mL), 并且将反应内容物用二氯甲烷萃取两次并且将合并的有机层经硫酸钠干燥并过滤。将所得残余物在硅胶 (环己烷/EtOAc 洗脱液梯度 1:0 至 1:1) 上通过快速色谱纯化, 以提供呈无色油状物的 1-[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]-*N*-甲氧基-甲胺 (410mg, 38% 产率)。LC/MS (方法 A) 停留时间 = 1.01 分钟, (M+H) 未检测到。

[0598]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ : 8.05 (t, 1H), 7.45 (m, 2H), 5.85 (brs, 1H), 4.12 (s, 2H), 3.50 (s, 3H)。

[0599]  $^{19}\text{F}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ : -65.21 (s), -107.33 (s)。

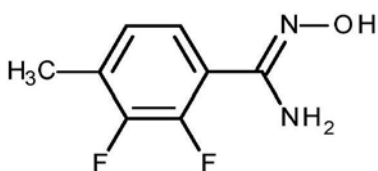
[0600] 实例 6: 该实例说明了中间体 1-[2,3-二氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]-*N*-甲氧基-甲胺的制备

[0601]



[0602] 步骤 1: 2,3-二氟-*N'*-羟基-4-甲基-苯甲脒的制备

[0603]

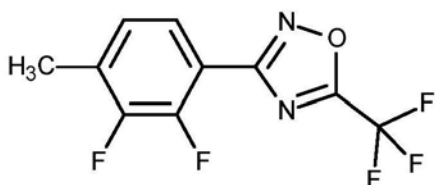


[0604] 在 25°C 下向 2,3-二氟-4-甲基苯甲脒 (5.0g, 32.6mmol) 在乙醇 (111mL) 中的悬浮液中添加羟胺盐酸盐 (4.5g, 65.3mmol)。将反应混合物在 80°C 下加热 2 小时。冷却至室温后, 将挥发物在减压下除去, 由此提供白色固体 (其不经纯化而用于下一步)。

[0605]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ : 7.30 (m, 1H), 6.95 (m, 1H), 6.50 (brs, 1H), 5.05 (brs, 2H), 2.30 (s, 3H)。

[0606] 步骤 2: 3-(2,3-二氟-4-甲基-苯基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑的制备

[0607]



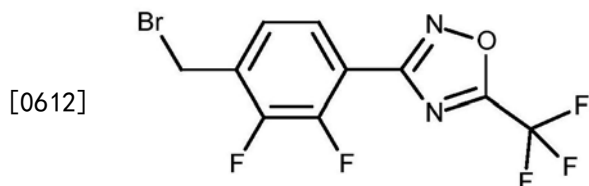
[0608] 向使用冰浴冷却的 2,3-二氟-*N'*-羟基-4-甲基-苯甲脒 (2.6mmol) 在四氢呋喃

(108mL) 中的溶液中添加TFAA (6.9mL, 49mmol)。将反应混合物在25℃下搅拌过夜并且然后用水稀释。将有机层分离, 依次用碳酸氢钠溶液、氯化铵溶液和水洗涤, 然后经硫酸钠干燥, 过滤并蒸发至干燥。粗标题化合物 (6.6g, 72%产率) 被分离为不经进一步纯化即用于下一转化的浅棕色固体。LC/MS (方法A) 保留时间=1.16分钟, 265 (M+H)。

[0609]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: 7.76 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 2.41 (s, 3H)。

[0610]  $^{19}\text{F}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: -65.41 (s), -133.3 (s), -140.1 (s)。

[0611] 步骤3: 3-[4-(溴甲基)-2,3-二氟-苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑的制备



[0613] 在氩气下将3-(2,3-二氟-4-甲基-苯基)-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑 (6.0g, 22.6mmol) 和NBS (7.17g, 10.0mmol) 在四氯甲烷 (79mL) 中的混合物加热至70℃。添加AIBN (0.68g, 3.95mmol), 并且将反应混合物在65℃下搅拌36小时。将混合物冷却至25℃, 用二氯甲烷和水稀释, 并且分离层。将琥珀酰亚胺副产物滤掉, 并且将溶剂在真空下除去, 以提供棕色胶状物。将此粗残余物在硅胶 (环己烷/EtOAc洗脱液梯度100:0至4:1) 上进行快速色谱, 以提供呈白色固体的标题化合物 (4.8g, 72%产率)。LC/MS (方法A) 保留时间=1.16分钟, 344 (M+H)。

[0614]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: 7.80 (m, 1H), 7.37 (m, 1H), 4.55 (s, 2H)。

[0615]  $^{19}\text{F}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: -65.1 (s), -131.2 (s), -139.1 (s)。

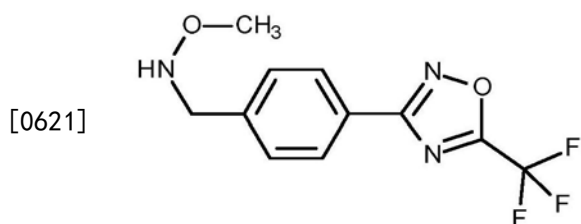
[0616] 步骤4: 1-[2,3-二氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]-N-甲氧基-甲胺的制备

[0617] 将二氯甲烷 (8mL) 中的O-甲基羟胺盐酸盐 (3.5g, 42mmol) 的溶液用DIPEA (8.3mL, 47mmol) 逐滴处理, 随后用二氯甲烷 (5mL) 中的3-[4-(溴甲基)-2,3-二氟-苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑 (2g, 5.2mmol) 的溶液处理。18h后, 引入水 (10mL), 并且将反应内容物用二氯甲烷萃取两次并且将合并的有机层经硫酸钠干燥并过滤。将所得残余物在硅胶 (环己烷/EtOAc洗脱液梯度1:0至1:1) 上通过快速色谱纯化, 以提供呈浅黄色油状物的1-[2,3-二氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]-N-甲氧基-甲胺 (1.1g, 68%产率)。LC/MS (方法A) 保留时间=1.03分钟, 310 (M+H)。

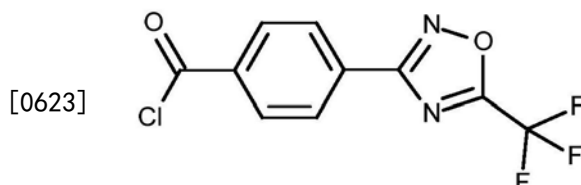
[0618]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: 7.84 (t, 1H), 7.38 (t, 1H), 5.87 (brs, 1H), 4.20 (s, 2H), 3.52 (s, 3H)。

[0619]  $^{19}\text{F}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: -65.21 (s), -132.53 (s), -147.50 (s)。

[0620] 实例7: 此实例说明了中间体N-甲氧基-1-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲胺的制备

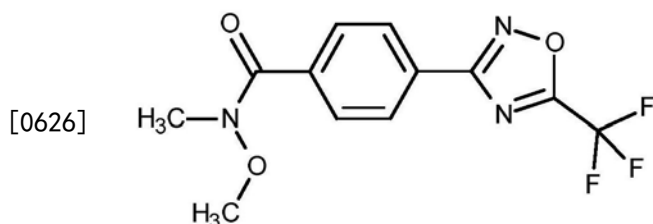


[0622] 步骤1:4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰氯的制备



[0624] 将4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酸(4.00g,15.0mmol)悬浮于二氯甲烷(90mL)中,添加DMF(0.01mL,0.150mmol),随后添加草酰氯(1.46mL,16.5mmol)。将混合物加热回流2小时。将混合物在减压下蒸发,以提供4.15g呈黄色固体的4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰氯。

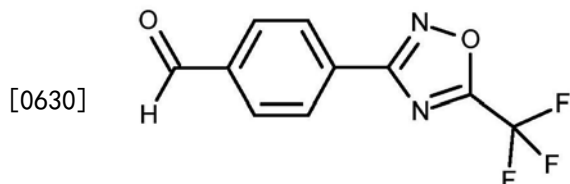
[0625] 步骤2:N-甲氧基-N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺的制备



[0627] 在室温下将二氯甲烷(20mL)中的来自步骤1的4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰氯(4.15g,14.6mmol)的溶液逐滴添加到二氯甲烷(80mL)中的N-甲氧基甲胺(1.10g,17.5mmol)和三乙胺(3.10mL,21.8mmol)的搅拌溶液中。将混合物在室温下搅拌18小时。将反应混合物倒入水中,用二氯甲烷萃取两次。将合并的有机层用盐水洗涤,经硫酸钠干燥并过滤。减压除去溶剂,并且使所得的粗残余物经受硅胶快速色谱法(庚烷:EtOAc洗脱剂梯度9:1至65:35)以提供4.12g呈固体的N-甲氧基-N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺。LC/MS(方法A)保留时间=0.97分钟,302(M+H)。

[0628]  $^1\text{H NMR}$  (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm:8.18(d,2H),7.84(d,2H),3.56(s,3H),3.40(s,3H)。

[0629] 步骤3:4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醛的制备



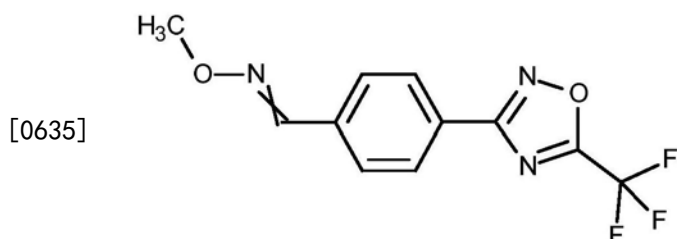
[0631] 在氩气下在 $-78^\circ\text{C}$ 下在配备有搅拌器、温度计的75-mL多颈烧瓶中,将甲苯中的DIBAL-H 1.0M(16mL,16.0mmol)逐滴添加到2-甲基四氢吡喃(90mL)中的N-甲氧基-N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺(4.10g,13.3mmol)的溶液中。将混合物在 $-78^\circ\text{C}$ 下搅拌2小时,并且在一小时内允许温度升高至 $0^\circ\text{C}$ 。通过LC/MS观察到完全转化。将

混合物通过逐滴添加饱和氯化铵溶液淬灭。出现白色固体的沉淀。添加4M HCl直至完全溶解。将混合物用乙酸乙酯萃取三次。将合并的有机物经硫酸镁干燥并蒸发,以提供呈米色固体的粗品。将粗品在硅胶(庚烷:EtOAc洗脱液梯度99:1至90:10)上进行快速色谱,以提供2.93g呈白色固体的4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醛,mp:40°C-50°C。

[0632]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ : 10.12 (s, 1H), 8.31 (d, 2H), 8.05 (d, 2H)。

[0633]  $^{19}\text{F}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ : -65.29 (s)。

[0634] 步骤4:N-甲氧基-1-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲亚胺的制备



[0636] 将甲醇(11mL)中的4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醛(0.30g, 1.1mmol)的溶液在室温下用吡啶(0.15mL, 1.9mmol)处理,随后添加O-甲基羟胺盐酸盐(0.15g, 1.8mmol)。将混合物在室温下搅拌过周末,倒在水上,用1M HCl酸化并用乙酸乙酯萃取三次。将合并的有机物用水洗涤,经硫酸镁干燥并蒸发,以提供树脂。将粗品在硅胶(庚烷:EtOAc洗脱液梯度100:0至95:5)上进行快速色谱,以提供呈白色固体的标题化合物,mp:55°C-65°C。

[0637]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ : 8.14 (s, 1H), 8.11 (d, 2H), 7.73 (d, 2H)。

[0638]  $^{19}\text{F}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ : -65.40 (s)。

[0639] 步骤5:N-甲氧基-1-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲胺的制备

[0640] 将乙酸(11mL)中的N-甲氧基-1-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲亚胺

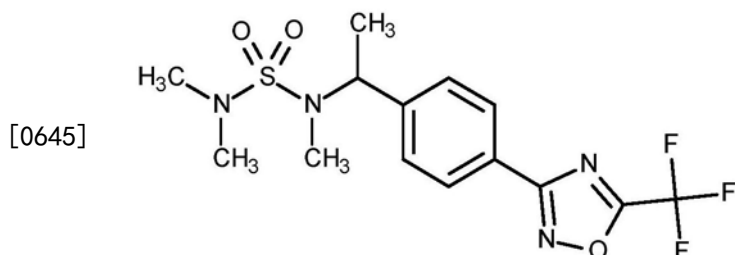
[0641] (0.81g, 2.89mmol)的溶液在15°C下用氰基硼氢化钠(0.4g, 6.1mmol)处理。将混合物在22°C下搅拌18小时,直至观察到起始材料完全消耗。将反应混合物小心地倒入0.1M NaOH溶液中。通过添加1M NaOH将pH调节至12-13。将混合物用TBME萃取四次。将合并的有机物用水洗涤两次,用盐水洗涤一次,然后经硫酸镁干燥并在减压下浓缩。将所得绿色油状物在硅胶(庚烷:EtOAc洗脱液梯度99:1至70:30)上通过快速色谱纯化,以得到0.60g呈油状物的标题化合物。

[0642]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ : 8.09 (d, 2H), 7.53 (d, 2H), 5.33 (brs, 1H), 4.12 (s, 2H), 3.50 (s, 3H)。

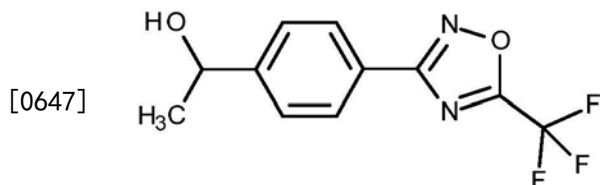
[0643]  $^{19}\text{F}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{ppm}}$ : -65.32 (s)。

[0644] 实例8:该实例说明N-(二甲基氨磺酰基)-N-甲基-1-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙胺(化合物1.110表T1)的制备





[0646] 步骤1:1-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙醇的制备

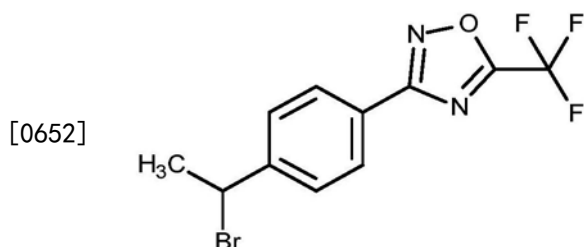


[0648] 在干燥的50mL烧瓶中和氩气下,将4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醛(1.36mol)溶解于THF(10mL)中并通过干冰丙酮浴冷却至-78℃。向此溶液中逐滴引入甲基溴化镁(0.70mL,2.03M,在乙醚中)。将混合物在-78℃下搅拌1小时,并且然后用饱和氯化铵水溶液淬灭。去除干冰浴,并将反应在室温下搅拌5分钟。然后将其用乙酸乙酯萃取。将合并的有机物经硫酸钠干燥并在减压下浓缩,以提供呈无色油状的粗品。将粗品在硅胶(庚烷:EtOAc洗脱液梯度99:1至1:1)上进行combiflash色谱,以提供呈白色固体状的1-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙醇。

[0649]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: 8.12 (d, 2H), 7.54 (d, 2H), 5.00 (s, 1H), 1.54 (d, 3H)。

[0650]  $^{19}\text{F}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: -65.31 (s)。

[0651] 步骤2:3-[4-(1-溴乙基)苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑的制备



[0653] 经30分钟向使用冰浴冷却至0℃的1-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙醇(1.15g, 4.45mmol)于二氯甲烷(15mL)中的溶液中添加三溴磷烷(0.465mL, 4.90mmol)并将反应混合物搅拌1.5小时。然后,用冰浴冷却内容物,并引入10%焦亚硫酸钠(50mL)。15分钟后,将水层用二氯甲烷萃取,并且将合并的总有机层用水洗涤,并且经 $\text{Na}_2\text{SO}_4$ 干燥,过滤并且在减压下浓缩。将所得粗残余物通过在硅胶上的combiflash色谱(使用环己烷作为洗脱液)进行纯化,以提供呈白色固体状的纯的3-[4-(1-溴乙基)苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑(1g, 71%产率)。

[0654]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: 8.12 (m, 2H), 7.60 (m, 2H), 5.25 (q, 1H), 2.10 (d, 3H)。

[0655]  $^{19}\text{F}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm: -65.31 (s)。

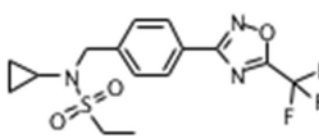
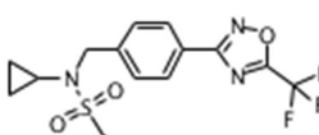
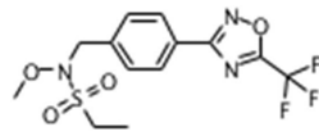
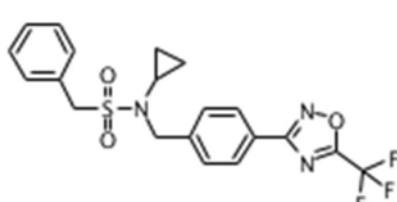
[0656] 步骤3:N-甲基-N-[1-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙基]甲烷磺酰胺的制备



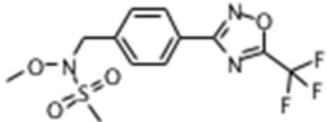
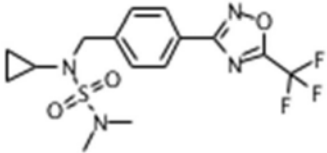
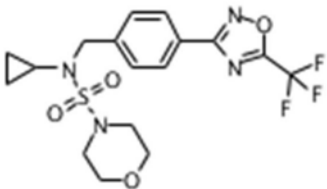
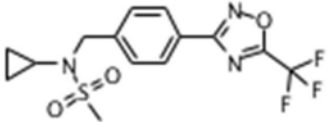
(600 $\mu$ L)的混合物中,并直接呈递用于制备型LC/MS纯化,以10%-85%产率提供具有式(I)的化合物。

[0668] 表T1:根据式(I)的化合物的熔点(mp)数据和/或保留时间(R<sub>t</sub>):

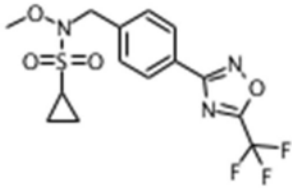
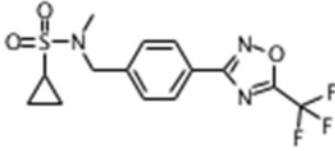
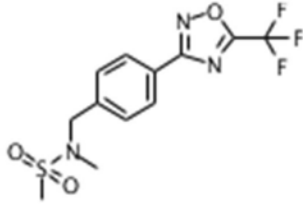
[0669]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.1	N-环丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙烷磺酰胺					86 - 88
1.2	N-环丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]环丙烷磺酰胺					90 - 92
1.3	N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙烷磺酰胺					44 - 46
1.4	N-环丙基-1-苯基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙烷磺酰胺		未观察到			

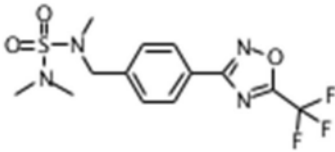
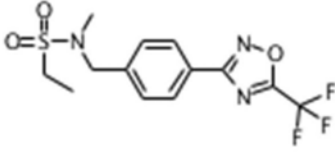
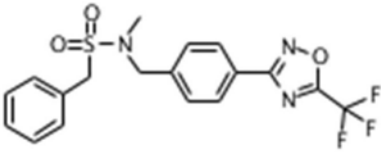
[0670]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	基]甲基]甲烷磺酰胺					
1.5	N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺					94 - 96
1.6	N-(二甲基氨基磺酰基)-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]环丙胺					82 - 84
1.7	N-环丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吗啉-4-磺酰胺					99 - 101
1.8	N-环丙基-N-[[4-[5-(三氟					84 - 86

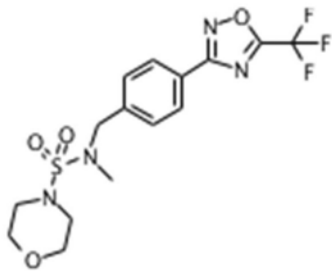
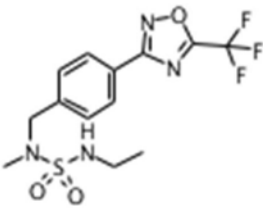
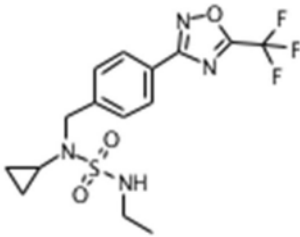
[0671]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺					
1.9	N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]环丙烷磺酰胺		1.77	378.07	B	73 - 75
1.10	N-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]环丙烷磺酰胺		1.67	362.08	B	102 - 105
1.11	N-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.52	336.08	B	103 - 105

[0672]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.12	N-(二甲基氨基磺酰基)-N-甲基-1-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲胺		1.70	365.10	B	77 - 79
1.13	N-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙烷磺酰胺		1.62	350.09	B	85 - 88
1.14	N-甲基-1-苯基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.85	412.09	B	109 - 111

[0673]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.15	N-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吗啉-4-磺酰胺					118 - 120
1.16	3-[4-[[乙基氨基磺酰基(甲基)氨基]甲基]苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑					63 - 66
1.17	3-[4-[[环丙基(乙基氨基磺酰基)氨基]甲基]苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑					108 - 110

[0674]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.18	3-[4-[[乙基 氨磺酰基(甲 氧基)氨基] 甲基]苯基]- 5-(三氟甲 基)-1,2,4-噁 二唑		1.73	未观察 到 (M + H)	C	
1.19	3-[4-[[甲基 (丙-2-炔基氨 磺酰基)氨 基]甲基]苯 基]-5-(三氟 甲基)-1,2,4- 噁二唑		1.51	374.9	C	
1.20	3-[4-[[环丙 基(丙-2-炔基 氨磺酰基)氨 基]甲基]苯 基]-5-(三氟 甲基)-1,2,4- 噁二唑		1.59	401.1	C	



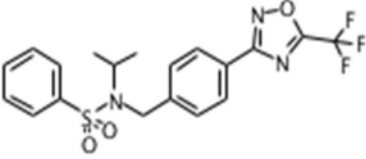
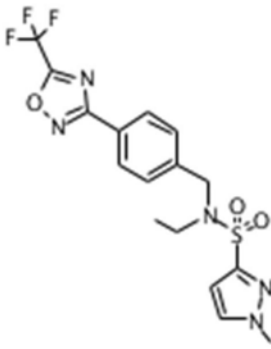
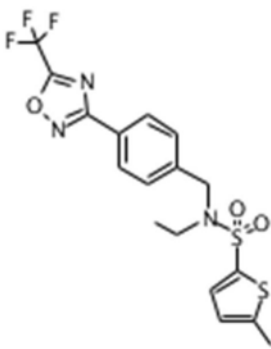
[0675]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.21	3-[4-[[环丙基(丙基氨磺酰基)氨基]甲基]苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑					70 - 73
1.22	3-[4-[[甲氧基(丙基氨磺酰基)氨基]甲基]苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑		1.15	395.29	C	
1.23	3-[4-[[甲基(丙基氨磺酰基)氨基]甲基]苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑		1.58	379	C	
1.24	N-乙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]		1.93	412.08	B	

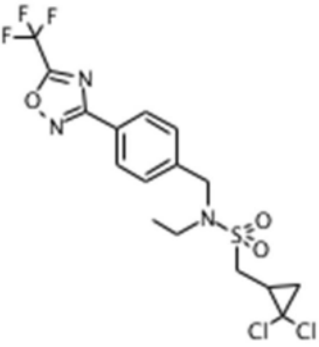
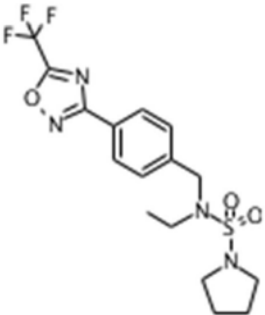
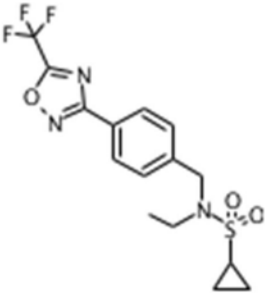
[0676]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	苯基]甲基]苯磺酰胺					
1.25	N-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙烷-1-磺酰胺		1.74	364.11	B	
1.26	N-丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙烷-1-磺酰胺		1.92	392.12	B	
1.27	N-丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]苯磺酰胺		2.02	426.1	B	

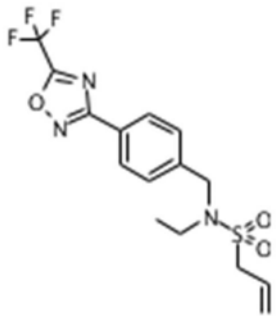
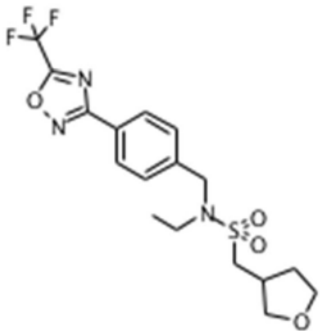
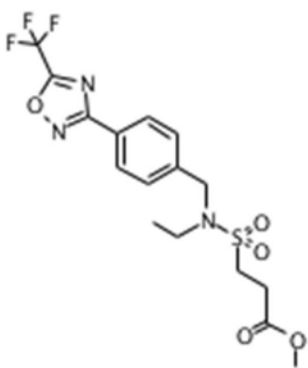
[0677]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.28	N-异丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]苯磺酰胺		1.99	426.1	B	
1.29	N-乙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡唑-3-磺酰胺		1.71	416.1	B	
1.30	N-乙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]噻吩-2-磺酰胺		2.01	432.06	B	

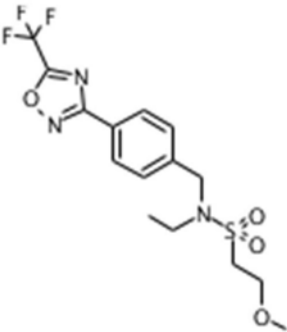
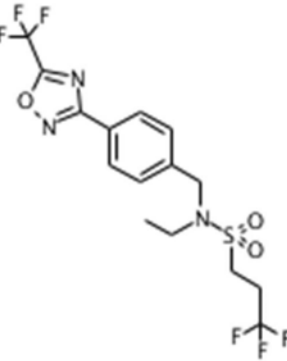
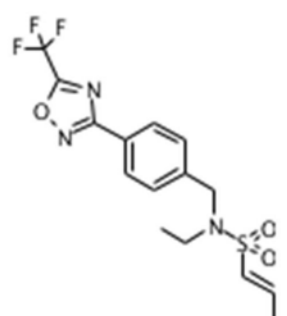
[0678]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.31	1-(2,2-二氯环丙基)-N-乙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.97	458.03	B	
1.32	N-乙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡咯烷-1-磺酰胺		1.88	405.13	B	
1.33	N-乙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]环丙烷磺酰胺		1.75	376.1	B	

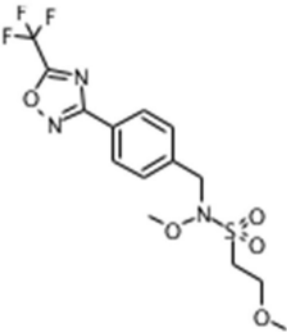
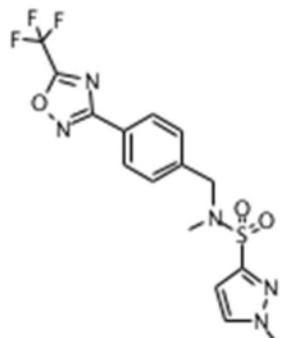
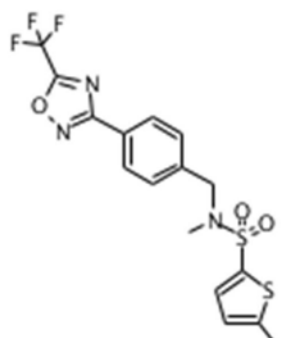
[0679]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.34	N-乙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙-2-烯-1-磺酰胺		1.77	376.1	B	
1.35	N-乙基-1-四氢呋喃-3-基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.71	420.13	B	
1.36	甲基 3-[乙基-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]氨磺酰基]丙酸酯		1.71	422.11	B	

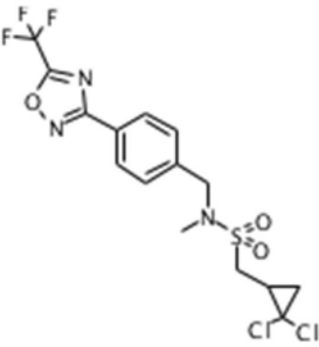
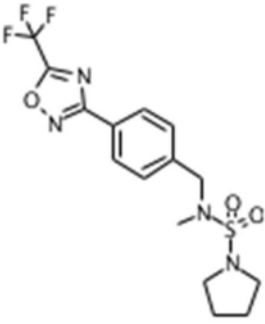
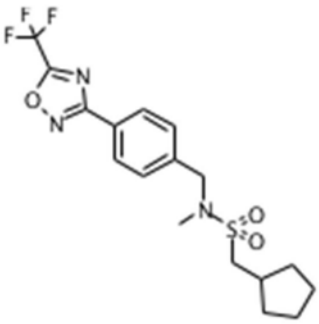
[0680]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.37	N-乙基-2-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙烷磺酰胺		1.70	394.12	B	
1.38	N-乙基-3,3,3-三氟-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙烷-1-磺酰胺		1.92	432.06	B	
1.39	(E)-N-乙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙-1-烯-1-磺酰胺		1.81	376.09	B	

[0681]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.40	N,2-二甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙烷磺酰胺		1.71	396.09	B	
1.41	N,1-二甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡唑-3-磺酰胺		1.63	402.10	B	
1.42	N,5-二甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]噻吩-2-磺酰胺		1.95	418.05	B	

[0682]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.43	1-(2,2-二氯环丙基)-N-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.90	444.01	B	
1.44	N-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡咯烷-1-磺酰胺		1.80	391.12	B	
1.45	1-环戊基-N-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.96	404.12	B	



[0683]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.46	N-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙-2-烯-1-磺酰胺		1.69	362.09	B	
1.47	N-甲基-1-四氢呋喃-3-基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.60	406.11	B	
1.48	甲基 3-[甲基-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]氨磺酰基]丙酸酯		1.63	408.08	B	

[0684]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.49	2-甲氧基-N-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙烷磺酰胺		1.62	380.09	B	
1.50	3,3,3-三氟-N-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙烷-1-磺酰胺		1.81	418.08	B	
1.51	(E)-N-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙-1-烯-1-磺酰胺		1.72	362.08	B	

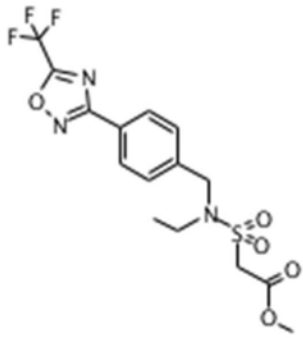
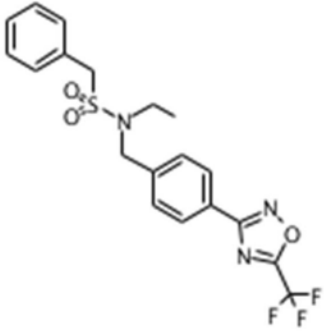
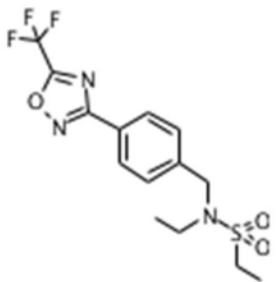
[0685]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.52	1-环丙基-N-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.78	376.11	B	
1.53	甲基 2-[甲基-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]氨基磺酰基]乙酸酯		1.62	394.08	B	
1.54	N-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙烷-2-磺酰胺		1.72	364.11	B	

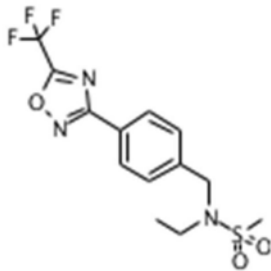
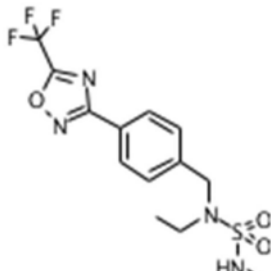
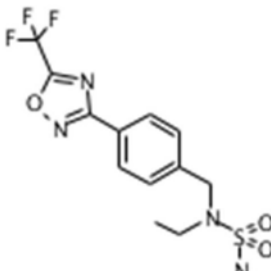
[0686]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.55	N-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丁烷-1-磺酰胺		1.84	378.11	B	
1.56	3-[4-[[甲基(甲基氨磺酰基)氨基]甲基]苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑		1.54	351.08	B	
1.57	甲基 2-[甲氧基-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]氨磺酰基]乙酸酯		1.71	410.07	B	
1.58	3-[4-[[甲氧基(甲基氨磺酰基)氨基]甲基]苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑		1.61	367.07	B	

[0687]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑					
1.59	甲基 2-[乙基-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]氮磺酰基]乙酸酯		1.68	408.08	B	
1.60	N-乙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.93	426.10	B	
1.61	N-乙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙烷磺酰胺		1.71	364.11	B	

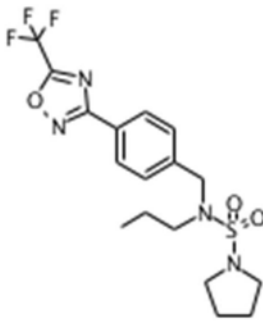
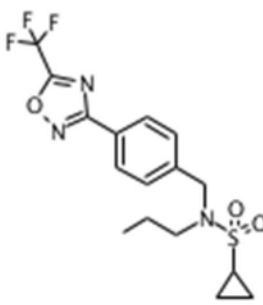
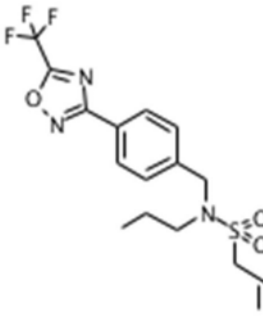
[0688]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.62	N-乙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.61	350.10	B	
1.63	3-[4-[[乙基(甲基氨基磺酰基)氨基]甲基]苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑		1.62	365.09	B	
1.64	N-(二甲基氨基磺酰基)-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙胺		1.79	379.10	B	

[0689]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.65	1-甲基-N-丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡唑-3-磺酰胺		1.79	430.12	B	
1.66	5-甲基-N-丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]噻吩-2-磺酰胺		2.09	446.08	B	
1.67	1-(2,2-二氯环丙基)-N-丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		2.06	472.05	B	

[0690]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.68	N-丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡咯烷-1-磺酰胺		1.98	419.14	B	
1.69	N-丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]环丙烷磺酰胺		1.85	390.12	B	
1.70	N-丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙-2-烯-1-磺酰胺		1.87	390.12	B	



[0691]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.71	N-丙基-1-四氢咪喃-3-基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.79	434.12	B	
1.72	甲基 3-[丙基-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]氨磺酰基]丙酸酯		1.80	436.12	B	
1.73	2-甲氧基-N-丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙烷磺酰胺		1.80	408.12	B	

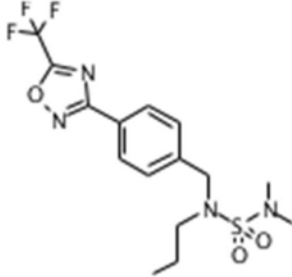
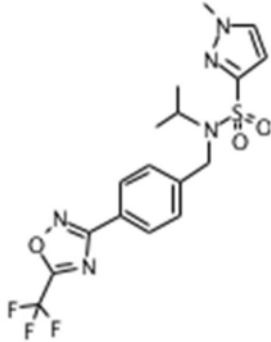
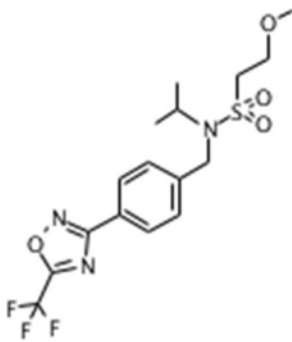
[0692]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.74	3,3,3-三氟-N-丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙烷-1-磺酰胺		2.81	446.08	B	
1.75	(E)-N-丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙-1-烯-1-磺酰胺		1.90	390.11	B	
1.76	甲基 2-[丙基-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]氨磺酰基]乙酸酯		1.78	422.10	B	

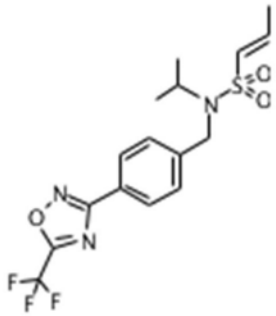
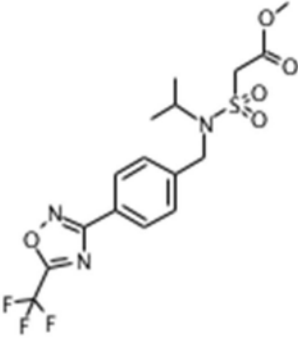
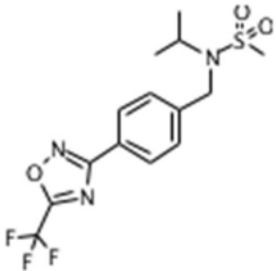
[0693]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.77	1-苯基-N-丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		2.01	440.12	B	
1.78	N-丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙烷磺酰胺		2.81	378.12	B	
1.79	N-丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.71	364.10	B	
1.80	3-[4-[[甲基氨基磺酰基(丙基)氨基]甲基]苯基]-5-(三氟甲基)-		1.73	379.10	B	

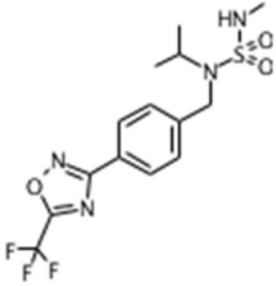
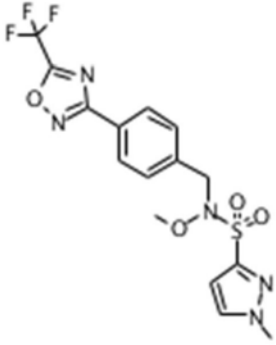
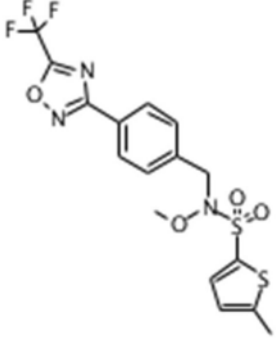
[0694]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	1,2,4-噁二唑					
1.81	N-(二甲基氨基磺酰基)-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙烷-1-胺		1.90	393.12	B	
1.82	N-异丙基-1-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡唑-3-磺酰胺		1.77	430.11	B	
1.83	N-异丙基-2-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙烷磺酰胺		1.79	408.12	B	

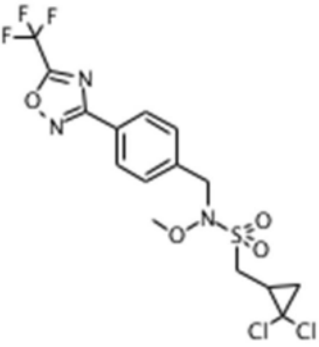
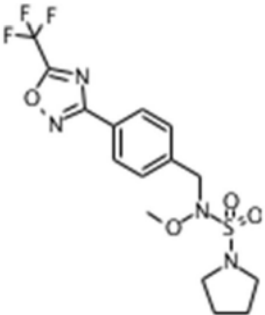
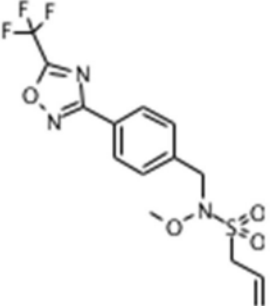
[0695]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.84	(E)-N-异丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙-1-烯-1-磺酰胺		1.87	390.12	B	
1.85	甲基 2-[异丙基-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]氨基磺酰基]乙酸酯		1.76	422.10	B	
1.86	N-异丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.69	364.08	B	

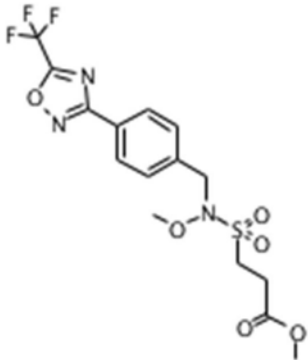
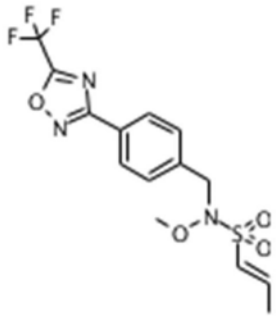
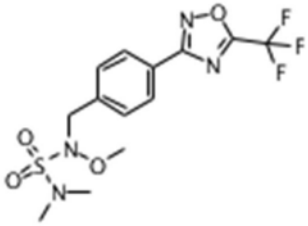
[0696]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.87	3-[4-[[异丙基(甲基氨基磺酰基)氨基]甲基]苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑		1.70	379.08	B	
1.88	N-甲氧基-1-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡唑-3-磺酰胺		1.69	418.08	B	
1.89	N-甲氧基-5-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]噻吩-2-磺酰胺		2.02	434.05	B	

[0697]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.90	1-(2,2-二氯环丙基)-N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		2.00	460.25	B	
1.91	N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡咯烷-1-磺酰胺		1.88	407.11	B	
1.92	N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙-2-烯-1-磺酰胺		1.79	378.36	B	

[0698]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.93	甲基 3-[甲氧基-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]氨基磺酰基]丙酸酯		1.73	424.07	B	
1.94	(E)-N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙-1-烯-1-磺酰胺		1.81	378.09	B	
1.95	N-(二甲基氨基磺酰基)-N-甲氧基-1-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲胺		1.78	381.08	B	



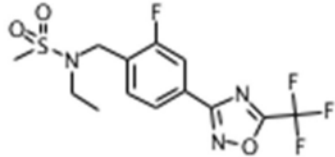
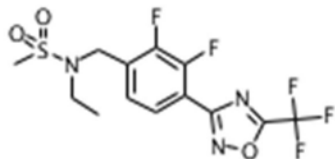
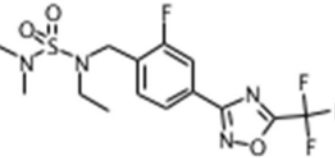
[0699]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.96	N-异丙基-5-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]噻吩-2-磺酰胺		2.07	446.10	B	
1.97	N-异丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡咯烷-1-磺酰胺		1.96	419.14	B	
1.98	N-异丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]环丙烷磺酰胺		1.82	390.13	B	

[0700]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.99	N-异丙基-1-苯基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.99	440.13	B	
1.100	N-(二甲基氨基磺酰基)-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙烷-2-胺		1.87	393.14	B	
1.101	N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]-N-甲氧基-甲烷磺酰胺		1.04	(M + H) 未观察到	A	
1.102	N-乙基-N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-		1.02	368	A	

[0701]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺					
1.103	N-乙基-N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺					90 - 93
1.104	N-[[2,3-二氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]-N-乙基-甲烷磺酰胺					81 - 83
1.105	N-(二甲基氨基磺酰基)-N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]		1.15	397.4	A	

[0702]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	甲基]乙胺					
1.106	N-(二甲基氨基磺酰基)-N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙胺		1.11	397.2	A	
1.107	N-[[2,3-二氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]-N-(二甲基氨基磺酰基)乙胺		1.13	415.2	A	
1.108	N-甲基-N-[1-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙基]甲烷磺酰胺		1.44	未观察到 (M + H)	C	

[0703]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
1.109	N-环丙基-N-[1-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙基]甲烷磺酰胺		1.57	未观察到 (M + H)	C	
1.110	N-(二甲基氨基磺酰基)-N-甲基-1-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙胺		未观察到			
1.111	N-甲氧基-N-[[5-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]-2-吡啶基]甲基]苯磺酰胺		1.10	415.3	A	
1.112	N-(二甲基氨基磺酰基)-N-甲氧基-1-[5-		未观察到			

[0704]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (min)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]-2-吡啶基]甲胺					

[0705] 表T2:根据式(I)的化合物的熔点(mp)数据和/或保留时间(R<sub>t</sub>):

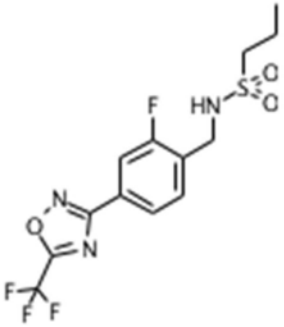
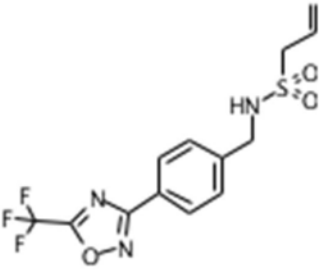
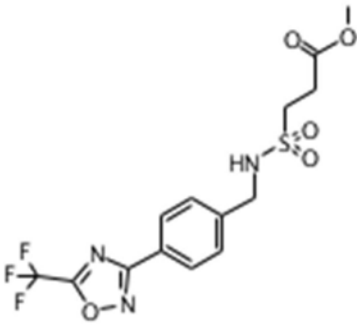
[0706]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
2.1	2-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙烷磺酰胺		1.44	366.08	B	97 - 100
2.2	N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]		1.43	336.08	B	127 - 129

[0707]

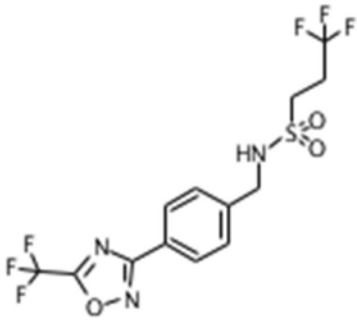
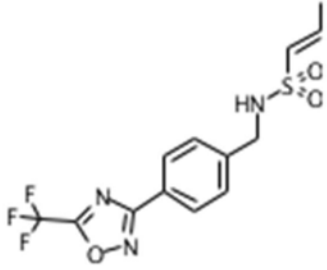
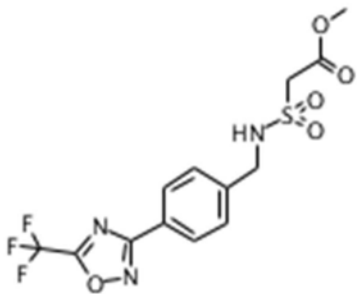
条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	甲基]乙烷磺酰胺					
2.3	3-[4-[(二甲基氨基磺酰基)甲基]苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑		1.52	351.08	B	105 - 107
2.4	N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙烷-1-磺酰胺		2.65	350.1	B	
2.5	N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙烷-		1.53	368.07	B	

[0708]

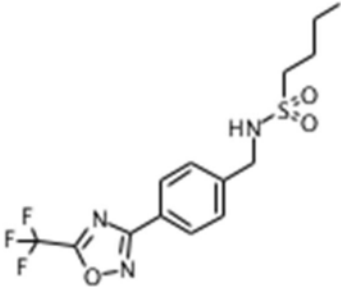
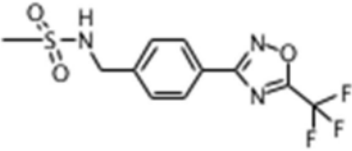
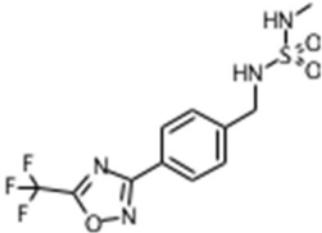
条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	1-磺酰胺					
2.6	N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙烷-1-磺酰胺		1.6	368.07	B	
2.7	N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙-2-烯-1-磺酰胺		1.5	348.06	B	
2.8	甲基 3-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]氨基磺酰基]		1.46	394.07	B	



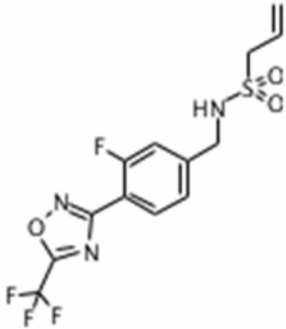
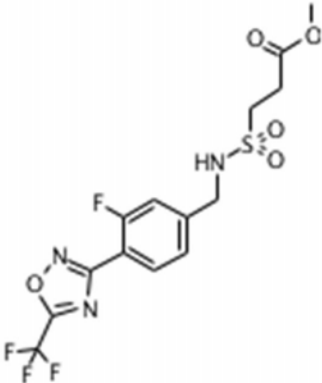
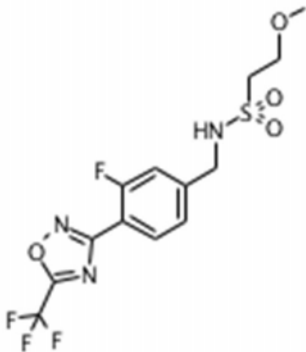
[0709]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	丙酸酯					
2.9	3,3,3-三氟-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙烷-1-磺酰胺		2.82	404.03	B	
2.10	(E)-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙-1-烯-1-磺酰胺		1.54	348.08	B	
2.11	甲基 2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙酸酯		2.82	380.03	B	

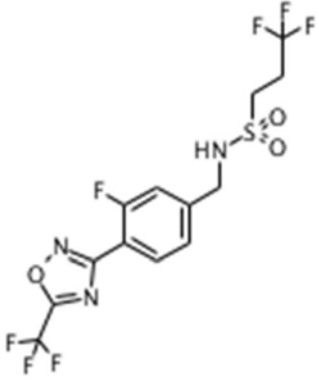
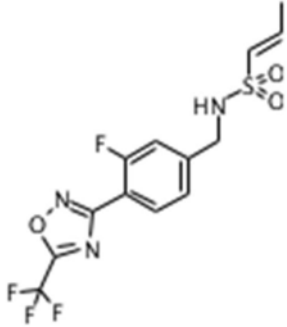
[0710]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	氮磺酰基] 乙酸酯					
2.12	N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丁烷-1-磺酰胺		1.67	364.1	B	
2.13	N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.35	322.06	B	
2.14	N-(甲基氮磺酰基)-1-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲胺		1.35	337.07	B	

[0711]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
2.15	N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙-2-烯-1-磺酰胺		1.49	366.26	B	
2.16	甲基 3-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]氨基磺酰基]丙酸酯		1.45	412.04	B	
2.17	N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲		1.43	384.06	B	

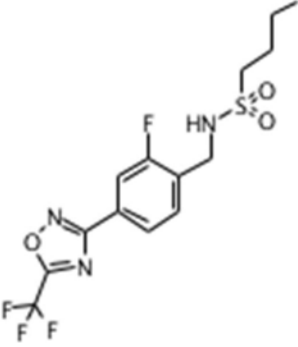
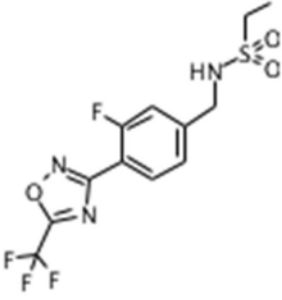
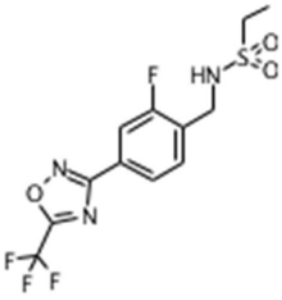
[0712]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	基]-2-甲 氧基-乙烷 磺酰胺					
2.18	3,3,3-三氟 -N-[[3-氟- 4-[5-(三氟 甲基)- 1,2,4-噁二 唑-3-基] 苯基]甲 基]丙烷- 1-磺酰胺		1.63	422.03	B	
2.19	(E)-N-[[3- 氟-4-[5- (三氟甲 基)-1,2,4- 噁二唑-3- 基]苯基] 甲基]丙- 1-烯-1-磺 酰胺		1.51	366.35	B	

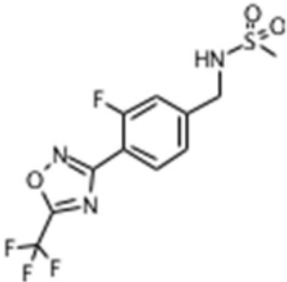
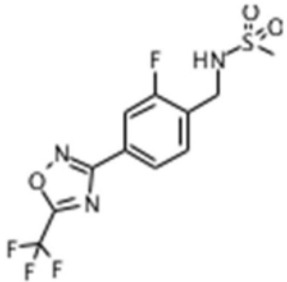
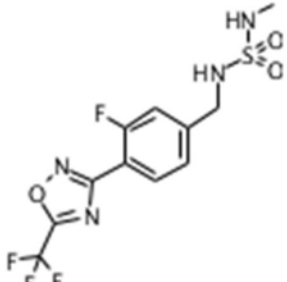
[0713]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
2.20	甲基 2-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基氨基磺酰基]乙酸酯		1.43	398.05	B	
2.21	N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]氨基磺酰胺		1.68	368.04	B	
2.22	N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]氨基磺酰胺		1.64	382.10	B	

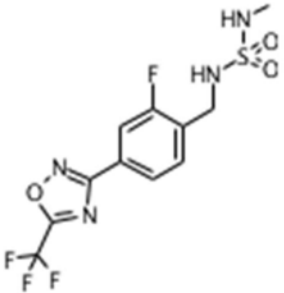
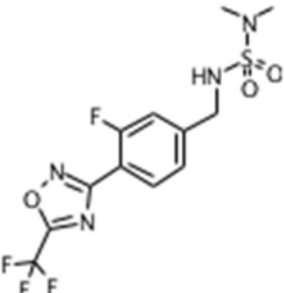
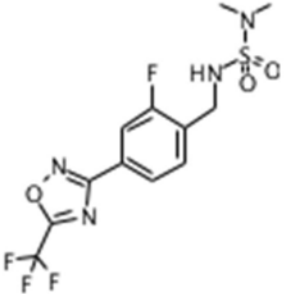
[0714]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	1-磺酰胺					
2.23	N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丁烷-1-磺酰胺		1.70	382.08	B	
2.24	N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙烷磺酰胺		1.42	354.08	B	
2.25	N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙烷磺酰胺		1.49	354.16	B	

[0715]

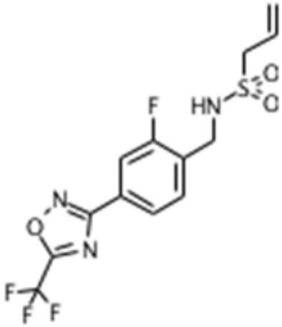
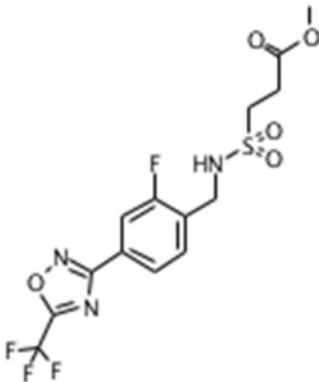
条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	酰胺					
2.26	N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.33	340.33	B	
2.27	N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.39	340.43	B	
2.28	1-[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]-N-(甲基氨磺		1.39	355.05	B	

[0716]

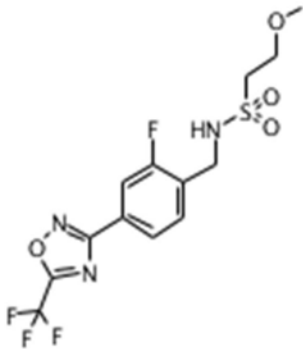
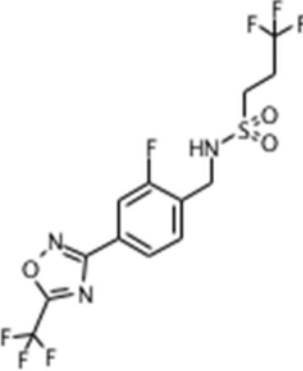
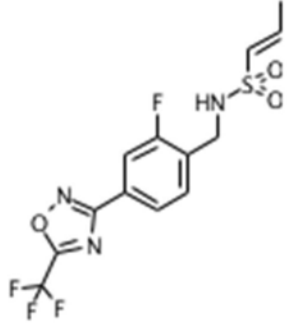
条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	酰基)甲胺					
2.29	1-[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]-N-(甲基氨磺酰基)甲胺		1.39	355.29	B	
2.30	3-[4-[(二甲基氨磺酰基氨基)甲基]-2-氟-苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑		1.50	369.07	B	
2.31	3-[4-[(二甲基氨磺酰基氨基)甲基]-3-氟-苯基]-5-(三氟甲基)-1,2,4-		1.57	369.06	B	



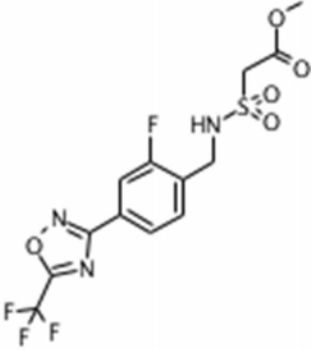
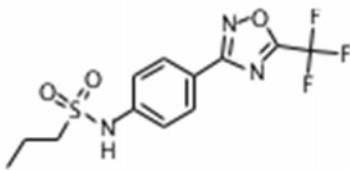
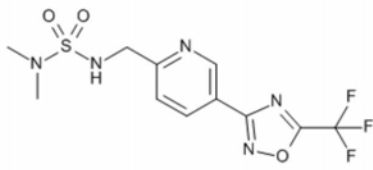
[0717]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	噁二唑					
2.32	N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙-2-烯-1-磺酰胺		1.55	366.08	B	
2.33	甲基 3-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]氨基磺酰基]丙酸酯		1.50	412.06	B	

[0718]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
2.34	N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]-2-甲氧基-乙烷磺酰胺		1.49	384.07	B	
2.35	3,3,3-三氟-N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙烷-1-磺酰胺		1.69	422.12	B	
2.36	(E)-N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]		1.58	366.08	B	

[0719]

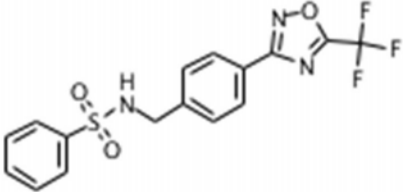
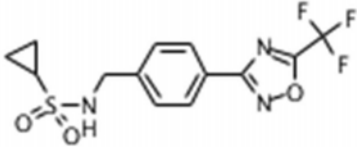
条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	甲基]丙-1-烯-1-磺酰胺					
2.37	甲基 2-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]氨基磺酰基]乙酸酯		1.49	398.26	B	
2.38	N-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]丙-1-磺酰胺					65 - 75
2.39	3-[6-[(二甲基氨基磺酰基)甲基]-3-吡啶基]-		0.90	352.3	A	

[0720]

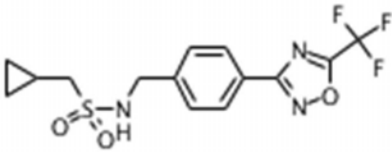
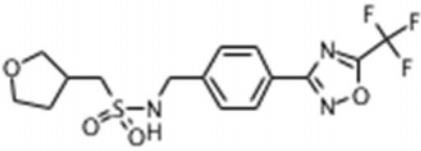
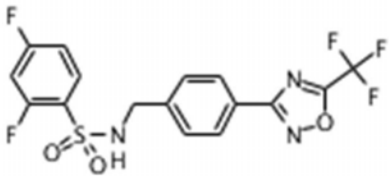
条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑					

[0721] 表T3:根据式(I)的化合物的熔点(mp)数据和/或保留时间(R<sub>t</sub>):

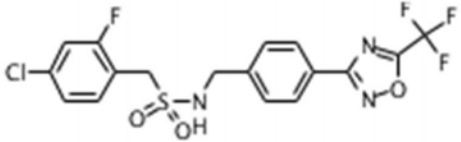
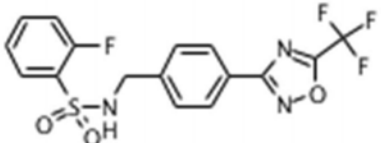
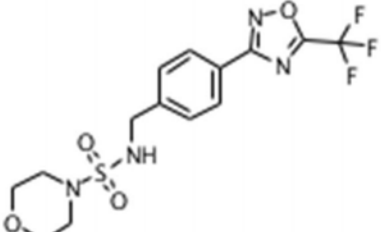
[0722]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
3.1	N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]苯磺酰胺		1.67	384.06	B	116 - 124
3.2	N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]环丙烷磺酰胺		2.81	348.08	B	130 - 134

[0723]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
3.3	1-环丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.57	362.09	B	140 - 144
3.4	1-四氢呋喃-3-基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.43	392.1	B	117 - 122
3.5	2,4-二氟-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]苯					112 - 115

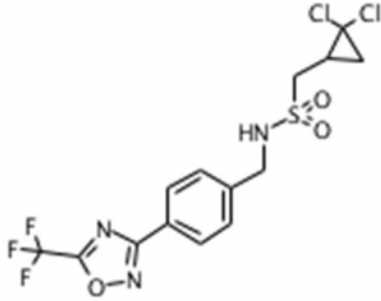
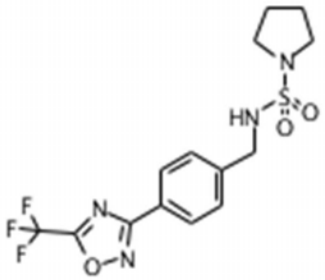
[0724]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	磺酰胺					
3.6	1-(4-氯-2-氟-苯基)-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺					140 - 144
3.7	2-氟-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]苯磺酰胺					120 - 123
3.8	N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吗啉磺酰胺					108 - 110

[0725]

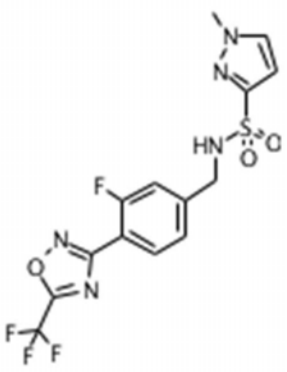
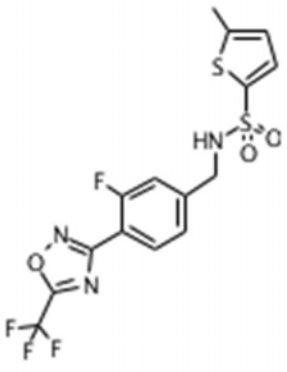
条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	喹-4-磺酰胺					
3.9	N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]苯基]苯磺酰胺		2.75	402.13	B	
3.10	1-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]吡唑-3-磺酰胺		1.42	388.08	B	
3.11	5-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-		1.74	404.02	B	

[0726]

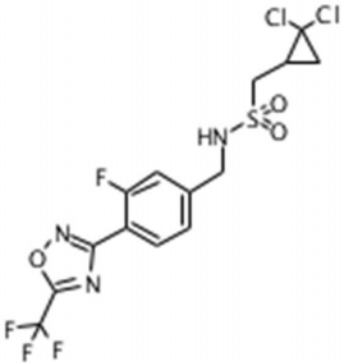
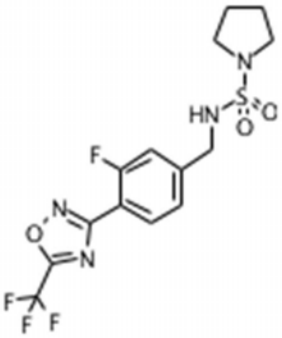
条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	基]苯基] 甲基]噻 吩-2-磺酰 胺					
3.12	1-(2,2-二 氯环丙 基)-N-[[4- [5-(三氟 甲基)- 1,2,4-噁 二唑-3- 基]苯基] 甲基]甲 烷磺酰胺		1.73	429.99	B	
3.13	N-[[4-[5- (三氟甲 基)-1,2,4- 噁二唑-3- 基]苯基] 甲基]吡 咯烷-1-磺 酰胺		1.61	377.09	B	



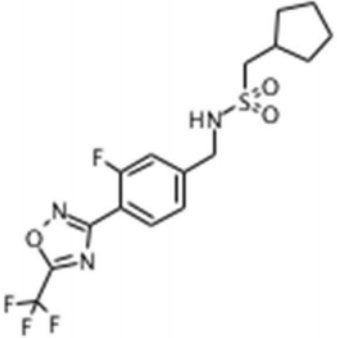
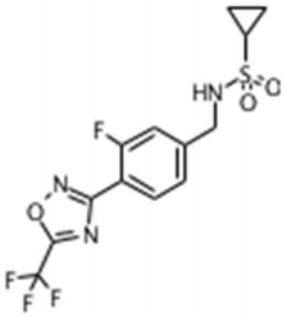
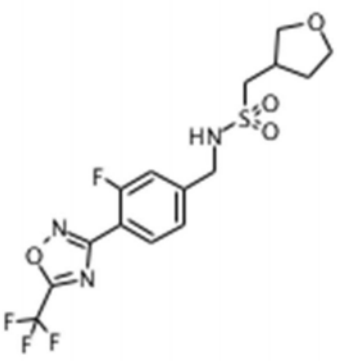
[0727]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
3.14	N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]-1-甲基-吡唑-3-磺酰胺		1.41	406.04	B	
3.15	N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]-5-甲基-噻吩-2-磺酰胺		1.71	422.00	B	

[0728]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
3.16	1-(2,2-二氯环丙基)-N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.71	448.19	B	
3.17	N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡咯烷-1-磺酰胺		1.59	395.08	B	

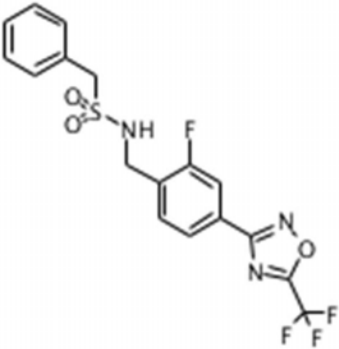
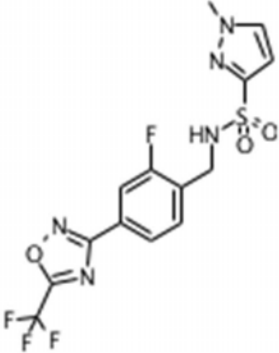
[0729]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
3.18	1-环戊基-N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.75	408.08	B	
3.19	N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]环丙烷磺酰胺		1.47	366.36	B	
3.20	N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]		1.41	410.18	B	

[0730]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	甲基]-1-四氢咪喃-3-基-甲烷磺酰胺					
3.21	1-环丙基-N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.54	379.89	B	
3.22	N-[[3-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]-1-苯基-甲烷磺酰胺		1.72	416.06	B	

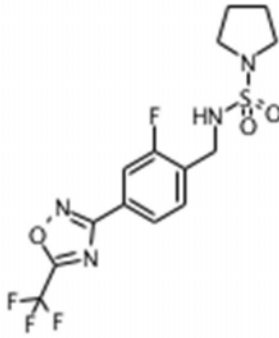
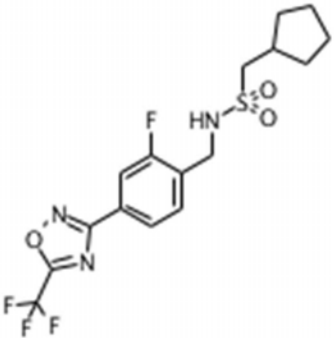
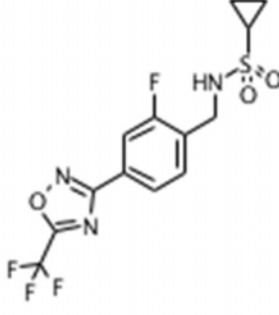
[0731]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
3.23	N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]-1-苯基-甲烷磺酰胺		1.72	416.09	B	
3.24	N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]-1-甲基-吡唑-3-磺酰胺		1.41	406.04	B	

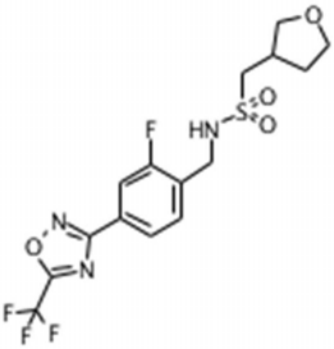
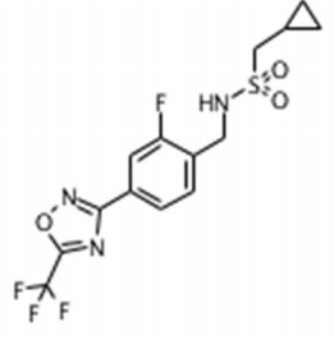
[0732]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
3.25	N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]-5-甲基-噻吩-2-磺酰胺		1.71	422.00	B	
3.26	1-(2,2-二氯环丙基)-N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.78	448.27	B	

[0733]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
3.27	N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡咯烷-1-磺酰胺		1.66	395.40	B	
3.28	1-环戊基-N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.82	408.10	B	
3.29	N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]		1.53	366.44	B	

[0734]

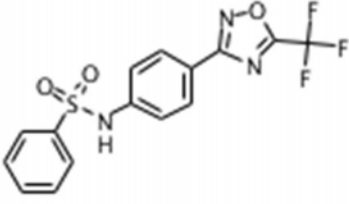
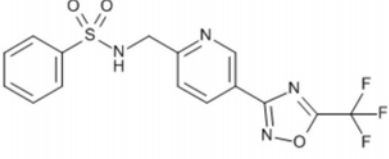
条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
	甲基]环丙烷磺酰胺					
3.30	N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]-1-四氢呋喃-3-基-甲烷磺酰胺		1.47	410.47	B	
3.31	1-环丙基-N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]甲烷磺酰胺		1.61	380.05	B	



[0735]

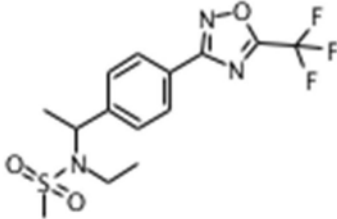
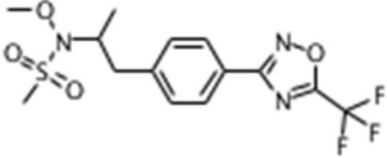
条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
3.32	N-[[2-氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]苯基]甲基]苯磺酰胺		1.70	402.42	B	
3.33	N-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]环丙烷磺酰胺					130 - 140
3.34	1-苯基-N-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲烷磺酰胺					125 - 135

[0736]

条目	IUPAC 名称	结构	R <sub>t</sub> (分钟)	[M + H] (测量的)	方法	mp (°C)
3.35	N-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]苯磺酰胺					115 - 130
3.36	N-[[5-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]-2-吡啶基]甲基]苯磺酰胺		0.98	385	A	

[0737] 表T4:根据式(I)的化合物的熔点(mp)数据和/或保留时间(R<sub>t</sub>):

[0738]

条目	IUPAC 名称	结构	RT (min)	[M + H] (测量的)	方法	MP °C
4.1	<i>N</i> -乙基- <i>N</i> -[1-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙基]甲烷磺酰胺		2.85	363.87	D	
4.2	<i>N</i> -甲氧基- <i>N</i> -[1-甲基-2-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙基]甲烷磺酰胺		1.12	380.4	A	

[0739] 生物学实例

[0740] 在孔板中叶圆片测试的一般实例:

[0741] 从生长于温室中的植物上切割不同植物物种的叶圆片或叶段。将切割的叶圆片或叶段置于多孔板(24孔规格)中的水琼脂上。在接种之前(预防性)或之后(治疗性),将叶圆片用测试溶液喷雾。将待测试的化合物制备成DMSO溶液(最大10mg/ml),将其在就要喷雾之前用0.025% Tween20稀释至适当浓度。根据对应的测试系统,在限定的条件(温度、相对湿度、光等)下孵育接种的叶圆片或叶段。取决于病害系统,接种后3至14天,进行疾病水平的单评估。然后计算相对于未处理的检验叶圆片或叶段的疾病控制百分比。

[0742] 在孔板中液体培养测试的一般实例:

[0743] 将真菌的菌丝体片段或分生孢子(从所述真菌的液体培养物或从低温储存物新鲜

制备)直接混入营养肉汤中。将测试化合物(最大10mg/ml)的DMSO溶液用0.025%的Tween20稀释50倍,并且将10 $\mu$ l的这种溶液用移液管移取到微量滴定板(96孔规格)中。然后将含有该真菌孢子/菌丝体片段的营养肉汤添加到其中,从而给出测试化合物的终浓度。将测试板在24 $^{\circ}$ C和96%相对湿度的黑暗中进行孵育。取决于病害系统,2至7天之后通过光度法测定真菌生长的抑制,并且计算相对于未处理的检验物而言的抗真菌活性百分比。

[0744] 实例1:针对小麦隐匿柄锈菌的杀真菌活性/小麦/叶圆片预防法(褐锈病)

[0745] 将小麦叶段栽培品种Kanzler置于多孔板(24孔规格)的琼脂上,并且用稀释在水中的配制的测试化合物喷雾。在施用后1天,用真菌的孢子悬液接种这些叶圆片。在气候室中,在12小时照明/12小时黑暗的光方案下,在19 $^{\circ}$ C和75%相对湿度(rh)下孵育经接种的叶段,并且化合物活性被评估为,在未处理的检验叶段中出现适当水平的疾病损害时(施用后7至9天),与未处理的相比的疾病控制百分比。

[0746] 在这一测试中,当在相同条件下与示出广泛的疾病发展的未处理的对照叶圆片相比时,在施用的配制品中以下化合物在200ppm下给出至少80%的疾病控制。

[0747] 化合物(来自表T1) 1.1、1.2、1.3、1.6、1.7、1.8、1.10、1.11、1.12、1.13、1.14、1.15、1.16、1.17、1.18、1.19、1.22、1.23、1.25、1.29、1.32、1.33、1.34、1.35、1.36、1.37、1.39、1.41、1.44、1.46、1.47、1.48、1.49、1.51、1.52、1.53、1.54、1.56、1.57、1.59、1.60、1.61、1.62、1.63、1.64、1.65、1.68、1.69、1.71、1.73、1.76、1.79、1.80、1.82、1.83、1.84、1.85、1.86、1.87、1.88、1.93、1.97、1.98、1.100、1.102、1.103、1.104、1.105、1.106、1.107、和1.111。

[0748] 化合物(来自表T2) 2.1、2.2、2.3、2.4、2.5、2.6、2.7、2.8、2.10、2.12、2.13、2.14、2.15、2.16、2.17、2.18、2.19、2.22、2.24、2.25、2.26、2.27、2.28、2.29、2.30、2.31、2.32、2.33、2.34、2.36、和2.37。

[0749] 化合物(来自表T3) 3.1、3.2、3.3、3.4、3.5、3.6、3.7、3.8、3.9、3.10、3.11、3.12、3.13、3.14、3.16、3.17、3.19、3.20、3.21、3.22、3.23、3.24、3.27、3.29、3.30、3.31、3.32、3.33、和3.35。

[0750] 化合物(来自表T4) 4.1和4.2。

[0751] 实例2:针对小麦隐匿柄锈菌的杀真菌活性/小麦/叶圆片治疗法(褐锈病)

[0752] 将小麦叶段栽培品种Kanzler置于多孔板(24孔规格)内的琼脂上。然后用真菌的孢子悬浮液接种叶段。在19 $^{\circ}$ C和75%相对湿度下,在黑暗中储存板。在接种后1天,施用在水中稀释的经配制的测试化合物。在气候室中,在12小时照明/12小时黑暗的光方案下,在19 $^{\circ}$ C和75%相对湿度下孵育叶段,并且化合物活性被评估为,在未处理的检验叶段中出现适当水平的疾病损害时(施用后6至8天),与未处理的相比的疾病控制百分比。

[0753] 在这一测试中,当在相同条件下与示出广泛的疾病发展的未处理的对照叶圆片相比时,在施用的配制品中以下化合物在200ppm下给出至少80%的疾病控制。

[0754] 化合物(来自表T1) 1.1、1.3、1.5、1.8、1.10、1.11、1.12、1.13、1.15、1.16、1.17、1.19、1.20、1.23、1.25、1.29、1.33、1.34、1.35、1.37、1.39、1.41、1.46、1.47、1.49、1.51、1.52、1.56、1.59、1.61、1.62、1.63、1.64、1.69、1.70、1.73、1.76、1.79、1.81、1.82、1.83、1.84、1.85、1.86、1.87、1.98、1.100、1.101、1.102、1.103、1.104、1.105、1.106、和1.107。

[0755] 化合物(来自表T2) 2.1、2.2、2.3、2.4、2.5、2.6、2.7、2.8、2.13、2.14、2.15、2.16、

2.17、2.19、2.21、2.24、2.25、2.26、2.27、2.28、2.29、2.30、2.31、2.32、2.34和2.36。

[0756] 化合物(来自表T3) 3.2、3.3、3.4、3.8、3.10、3.14、3.17、3.19、3.20、3.21、3.24、3.27、3.29、3.30、和3.31。

[0757] 化合物(来自表T4) 4.1。

[0758] 实例3:针对豆薯层锈菌的杀真菌活性/大豆/叶圆片预防法(亚洲大豆锈病)

[0759] 将大豆叶圆片置于多孔板(24孔规格)中的水琼脂上,并且用在水中稀释的配制的测试化合物进行喷雾。施用后一天,通过在下部叶表面喷雾孢子悬浮液来接种叶圆片。在气候室中,在黑暗中在20℃和75%rh下的24-36小时的孵育期之后,用12h照明/天和75%rh将叶圆片保持在20℃。当在未处理的检验叶圆片中出现适当水平的疾病损害时(施用后12至14天),将化合物的活性评估为与未处理的相比的疾病控制百分比。

[0760] 在这一测试中,当在相同条件下与示出广泛的疾病发展的未处理的对照叶圆片相比时,在施用的配制品中以下化合物在200ppm下给出至少80%的疾病控制。

[0761] 化合物(来自表T1) 1.1、1.2、1.3、1.8、1.10、1.11、1.12、1.13、1.15、1.16、1.17、1.23、1.101、1.102、1.103、和1.104。

[0762] 化合物(来自表T2) 2.1、2.2、2.3和2.38。

[0763] 化合物(来自表T3) 3.2、3.3、3.4、3.7、3.33、和3.35。

[0764] 化合物(来自表T4) 4.1和4.2。

[0765] 实例4:针对瓜类小丛壳(瓜类刺盘孢)液体培养物的杀真菌活性/黄瓜/预防法(炭疽病)

[0766] 将来自低温储存的真菌分生孢子直接混入营养肉汤(PDB-马铃薯右旋糖肉汤)中。在将测试化合物的(DMSO)溶液置于微量滴定板(96孔规格)中之后,添加含有真菌孢子的营养培养液。将测试板在24℃孵育并且在施用后3至4天通过光度法测量对生长的抑制。

[0767] 在这一测试中,当在相同条件下与示出广泛的疾病发展的未处理的对照相比时,在施用的配制品中以下化合物在20ppm下给出至少80%的疾病控制。

[0768] 化合物(来自表T1) 1.1、1.2、1.3、1.4、1.5、1.6、1.7、1.8、1.9、1.10、1.11、1.12、1.13、1.14、1.15、1.16、1.17、1.18、1.19、1.20、1.21、1.22、1.23、1.24、1.25、1.26、1.29、1.31、1.32、1.33、1.34、1.35、1.36、1.37、1.39、1.40、1.41、1.44、1.46、1.47、1.48、1.49、1.51、1.52、1.53、1.54、1.55、1.56、1.58、1.59、1.60、1.61、1.62、1.63、1.64、1.65、1.68、1.69、1.70、1.71、1.72、1.73、1.75、1.76、1.77、1.78、1.79、1.80、1.81、1.82、1.83、1.84、1.85、1.86、1.87、1.92、1.93、1.94、1.97、1.98、1.99、1.100、1.101、1.102、1.103、1.104、1.105、1.106、1.107、和1.111。

[0769] 化合物(来自表T2) 2.1、2.2、2.3、2.4、2.5、2.6、2.7、2.8、2.10、2.11、2.12、2.13、2.14、2.15、2.16、2.17、2.18、2.19、2.20、2.22、2.23、2.24、2.25、2.26、2.27、2.28、2.29、2.30、2.31、2.32、2.33、2.34、2.36、2.37、和2.38。

[0770] 化合物(来自表T3) 3.1、3.2、3.3、3.4、3.7、3.8、3.9、3.10、3.11、3.12、3.13、3.14、3.15、3.16、3.17、3.19、3.20、3.21、3.24、3.25、3.27、3.29、3.30、3.31、3.33、3.34、和3.35。

[0771] 化合物(来自表T4) 4.1和4.2。