

(12) 按照专利合作条约所公布的国际申请

(19) 世界知识产权组织
国际局

(43) 国际公布日
2018 年 4 月 19 日 (19.04.2018)



(10) 国际公布号
WO 2018/068773 A2

(51) 国际专利分类号:

A01N 63/04 (2006.01) *A01P 1/00* (2006.01)
A01N 43/80 (2006.01) *A01P 3/00* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2017/115359

(22) 国际申请日: 2017 年 12 月 9 日 (09.12.2017)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

201610889263.1 2016 年 10 月 11 日 (11.10.2016) CN

(71) 申请人: 江苏辉丰生物农业股份有限公司 (JIANGSU HUIFENG BIO AGRICULTURE CO., LTD.) [CN/CN]; 中国江苏省盐城市大丰区城北新区迎宾大道 1 号江苏辉丰生物农业股份有限公司 17 楼登记部, Jiangsu 224100 (CN)。

(72) 发明人: 季红进(JI, Hongjin); 中国江苏省盐城市大丰区城北新区迎宾大道 1 号江苏辉丰生物农业股份有限公司 17 楼登记部, Jiangsu 224100 (CN)。
仲汉根(ZHONG, Hangen); 中国江苏省盐城市大丰区城北新区迎宾大道 1 号江苏辉丰生物农业

股份有限公司 17 楼登记部, Jiangsu 224100 (CN)。
花伟(HUA, Wei); 中国江苏省盐城市大丰区城北新区迎宾大道 1 号江苏辉丰生物农业股份有限公司 17 楼登记部, Jiangsu 224100 (CN)。

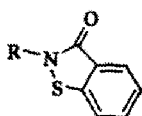
(74) 代理人: 南京天华专利代理有限责任公司 (NANJING TIANHUA PATENT AGENT CO., LTD.); 中国江苏省南京市鼓楼区山西路 67 号世贸中心大厦 A1 座 23 层, Jiangsu 210009 (CN)。

(81) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的国家保护): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW。

(84) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的地区保护): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ,

(54) Title: BACTERICIDAL COMPOSITION CONTAINING BENZISOTHIAZOLINONE AND ALTERNARIA TENUISSIMA ACTIVATOR PROTEIN

(54) 发明名称: 含苯并异噻唑啉酮类和极细链格孢激活蛋白的杀菌组合物



(I)

(57) Abstract: Provided is a bactericide composition. Said composition includes two active ingredients, A and B, active component A being a compound having the structure of formula (I), active component B being alternaria tenuissima activator protein, the weight ratio of the two components being 20-1:1-20. Also provided are a preparation method for the composition and a use of the composition. Test results show that the bactericidal composition provided in the present invention has significant synergy and, more importantly, reduced application amounts and decreased usage costs. The present bactericidal composition effectively prevents and treats certain bacteria or fungal diseases of crops. By compounding bactericides having different mechanisms and modes of action, the bactericidal spectrum is expanded, fungi and bacterial resistance are delayed, and the prevention and treatment effect is improved.

(57) 摘要: 本发明提供了一种杀菌剂组合物, 该组合物包含两种有效成分 A 和 B, 活性组分 A 为具有式 (I) 的结构化合物, 活性组分 B 为极细链格孢激活蛋白, 两组分之间的重量比为 20~1:1~20。本发明还提供了该组合物的制备方法及其用途。试验结果表明, 本发明提供的上述杀菌组合物增效明显, 更重要的是施用量减少, 使用成本降低。该杀菌组合物能有效防治作物的某些特定的细菌或真菌病害。通过将不同作用机制和作用方式的杀菌剂进行复配, 对于扩大杀菌谱和延缓真菌、细菌抗性以及提高防治效果等方面具有很好的作用。

NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), 欧洲 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG)。

本国际公布：

- 不包括国际检索报告，在收到该报告后将重新公布(细则48.2(g))。
- 包括关于请求恢复一项或多项优先权要求的信息(细则26之二.3和48.2(b)(vii))。

含苯并异噻唑啉酮类和极细链格孢激活蛋白的杀菌组合物

技术领域

本发明属于农业植物保护领域，特别是涉及一种具有改进性能的杀菌组合物，具体地说是涉及一种包含苯并异噻唑啉酮类和极细链格孢激活蛋白的杀菌组合物。

背景技术

苯并异噻唑啉酮类化合物是一种新型、广谱杀菌剂，主要用于防治和治疗禾谷类作物、蔬菜、水果等多种细菌、真菌性病害。其杀菌作用机理，主要包括破坏病菌细胞核结构，使其失去心脏部位而衰竭死亡和干扰病菌细胞的新陈代谢，使其生理紊乱，最终导致死亡两个方面。在病害发生初期使用可有效保护植株不受病原物侵染，病害发生后酌情增加用药量可明显控制病菌的蔓延，从而达到保护和铲除的双重作用。

极细链格孢激活蛋白（plant activator protein）是从交链孢菌中筛选、分离、纯化出的一类新型蛋白，主要通过激活植物体内分子免疫系统，提高植物自身免疫力；通过激发植物体内的一系列代谢调控，促进植物根、茎、叶生长和提高叶绿素含量，提高作物产量，对多种植物病害有较高的防效。

实际的农药经验已经表明，重复且专一施用一种活性化合物来防治有害真菌在很多情况下将导致真菌菌株的快速选择性，为降低抗性真菌菌株选择性的危险性，目前通常使用不同活性化合物的混合物来防治有害真菌。通过将具有不同作用机理的活性化合物进行组合，可延缓抗性产生，降低施用量，减少防治成本。

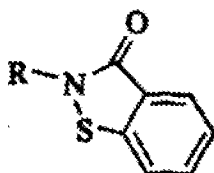
发明内容

本发明的目的是针对杀菌剂在实际应用中抗性以及土壤残留问题，筛选出不同杀菌原理的杀菌剂进行复配，得到新的一种杀菌剂组合物，以提高杀菌剂防治效果，延缓抗性产生，降低施用量，减少防治成本。

本发明的另一个目的是提供包含两种有效成分 A 和 B 的杀菌组合物在农业领域防治农作物病害中的应用。

本发明的目的可以通过以下措施达到：

一种具有增效作用的杀菌剂组合物，该组合物包含 A 和 B 两种活性组分，其中活性组分 A 为具有式（I）的结构化合物，活性组分 B 为极细链格孢激活蛋白。



式（I）

式 (I) 中, R 选自 H 或 $C_1 \sim C_8$ 烷基。

本发明中的 $C_1 \sim C_8$ 烷基是指含有 1 至 8 个碳原子的直链或支链烷基, 它包括 C_1 烷基 (如甲基)、 C_2 烷基 (如乙基)、 C_3 烷基 (如正丙基、异丙基)、 C_4 烷基 (如正丁基、异丁基、叔丁基、仲丁基)、 C_5 烷基 (如正戊基等)、 C_6 烷基、 C_7 烷基、 C_8 烷基。它包括但不限于 $C_1 \sim C_6$ 烷基、 $C_1 \sim C_5$ 烷基、 $C_1 \sim C_4$ 烷基等。

在一种优选方案中, R 选自 H 或 $C_1 \sim C_4$ 烷基。

在一种更优选的方案中, R 选自 H、 $-CH_3$ 或 $-C_4H_9$ 。

式 (I) 中, 当 R 为 H 时, A 为 1,2-苯并异噻唑啉-3-酮 (说明书中简称 BIT)。

式 (I) 中, 当 R 为 CH_3 时, A 为 2-甲基-1,2-苯并异噻唑啉-3-酮 (说明书中简称 MBIT)。

式 (I) 中, 当 R 为 C_4H_9 时, A 为 2-丁基-1,2-苯并异噻唑啉-3-酮, 该式中的“丁基”优选正丁基 (说明书中简称 BBIT)。

发明人通过试验发现, 本发明的组合物是用于防治农作物细菌或真菌性病害, 防治增效明显, 更重要的是施用量减少, 降低使用成本。含有组分 A 与组分 B 的化合物结构类型不同, 作用机制各异, 两者复配能够扩大杀菌谱, 并且可以在一定程度上延缓病原菌抗性的产生和发展速度, 且组分 A 与组分 B 之间无交互抗性。

本发明杀菌剂组合物中的两组分之间的重量比为 $30 \sim 1:1 \sim 30$ 。为使两组分间的药效增效作用更为显著, 组分 A 和组分 B 两组分之间的重量比可以进一步优化至 $20 \sim 1:1 \sim 20$ 。

一种优选的方案中, A 和 B 两组分之间的重量比可以任意地在下述配比的范围内进行调整 $30:1$ 、 $29:1$ 、 $28:1$ 、 $27:1$ 、 $26:1$ 、 $25:1$ 、 $24:1$ 、 $23:1$ 、 $22:1$ 、 $21:1$ 、 $20:1$ 、 $19:1$ 、 $18:1$ 、 $17:1$ 、 $16:1$ 、 $15:1$ 、 $14:1$ 、 $13:1$ 、 $12:1$ 、 $11:1$ 、 $10:1$ 、 $9:1$ 、 $8:1$ 、 $7:1$ 、 $6:1$ 、 $5:1$ 、 $4:1$ 、 $3:1$ 、 $2:1$ 、 $1:1$ 、 $1:2$ 、 $1:3$ 、 $1:4$ 、 $1:5$ 、 $1:6$ 、 $1:7$ 、 $1:8$ 、 $1:9$ 、 $1:10$ 、 $1:11$ 、 $1:12$ 、 $1:13$ 、 $1:14$ 、 $1:15$ 、 $1:16$ 、 $1:17$ 、 $1:18$ 、 $1:19$ 、 $1:20$ 、 $1:21$ 、 $1:22$ 、 $1:23$ 、 $1:24$ 、 $1:25$ 、 $1:26$ 、 $1:27$ 、 $1:28$ 、 $1:29$ 、 $1:30$, 也可以在以上任意两个配比所组成的范围内进行选择, 这些比例可以理解为重量与体积比值, 或质量比, 也可以包括摩尔比。

本发明的组合物可以由活性成分和农药助剂或辅料制成农药上允许的剂型。进一步的, 该组合物由 $2 \sim 80\%$ 重量份的活性组分与 $98 \sim 20\%$ 重量份的农药助剂或辅料制成农药上允许的剂型。

本发明提供了包含组分 A 和组分 B 的杀菌组合物在农业领域防治农作物病害方面的用途, 特别是在防治某些作物的真菌或细菌性病害方面的用途。

上述组合物具体可包含农药助剂或辅料，例如载体、溶剂、分散剂、润湿剂、胶粘剂、增稠剂、粘合剂、表面活性剂或肥料等中的一种或几种。在施用的过程中可以混合常用的助剂。

合适的助剂或辅料可以是固体或液体，它们通常是剂型加工过程中常用的物质，例如天然的或再生的矿物质，溶剂、分散剂、润湿剂、胶粘剂、增稠剂、粘合剂。

本发明组合物的施用方法包括将本发明的组合物用于植物生长的地上部分，特别是叶部或叶面。可以选择浸种或涂抹于防治对象表面。施用的频率和施用量取决于病原体的生物学和气候生存条件。可以将植物的生长场所，如稻田，用组合物的液体制剂浸湿，或者将组合物以固体形式施用于土壤中，如以颗粒形式（土壤施用），组合物可以由土壤经植物根部进入植物体内（内吸作用）。

本发明的组合物可以制备成农药上可接受的各种剂型，包括但不限于乳油、悬浮剂、可湿性粉剂、水分散粒剂、粉剂、粒剂、水剂、水乳剂、微乳剂、毒饵、母液、母粉等，在一种优选方案中，本发明的剂型采用可湿性粉剂、悬浮剂、水分散粒剂、水乳剂或微乳剂。根据这些组合物的性质以及施用组合物所要达到的目的和环境情况，可以选择将组合物以喷雾、弥雾、喷粉、撒播或泼浇等之类的方法施用。

可用已知的方法可以将本发明的组合物制备成各种剂型，可以将有效成分与助剂，如溶剂、固体载体，需要时可以与表面活性剂一起均匀混合、研磨，制备成所需要的剂型。

上述的溶剂可选自芳香烃，优选含 8-12 个碳原子，如二甲苯混合物或取代的苯，酞酸酯类，如酞酸二丁酯或酞酸二辛酸，脂肪烃类，如环己烷或石蜡，醇和乙二醇和它们的醚和酯，如乙醇，乙二醇，乙二醇单甲基；酮类，如环己酮，强极性的溶剂，如 N-甲基-2-吡咯烷酮，二甲基亚砷或二甲基甲酰胺，和植物油或植物油，如大豆油。

上述的固体载体，如用于粉剂和可分散剂的通常是天然矿物填料，例如滑石、高岭土，蒙脱石或活性白土。为了管理组合物的物理性能，也可以加入高分散性硅酸或高分散性吸附聚合物载体，例如粒状吸附载体或非吸附载体，合适的粒状吸附载体是多孔型的，如浮石、皂土或膨润土；合适的非吸附载体如方解石或砂。另外，可以使用大量的无机性质或有机性质的预制成粒状的材料作为载体，特别是白云石。

根据本发明的组合物中的有效成分的化学性质，合适的表面活性剂为木质素磺酸、萘磺酸、苯酚磺酸、碱土金属盐或胺盐，烷基芳基磺酸盐，烷基硫酸盐，烷基磺酸盐，脂肪醇硫酸盐，脂肪酸和硫酸化脂肪醇乙二醇醚，还有磺化萘和萘衍生物与甲醛的缩合物，萘或萘磺酸与苯酚和甲醛的缩合物，聚氧乙烯辛基苯基醚，乙氧基化异辛基酚，辛基酚，壬基酚，烷

基芳基聚乙二醇醚，三丁基苯聚乙二醇醚，三硬脂基苯基聚乙二醇醚，烷基芳基聚醚醇，乙氧基化蓖麻油，聚氧乙烯烷基醚，氧化乙烯缩合物、乙氧基化聚氧丙烯，月桂酸聚乙二醇醚缩醛，山梨醇酯，木质素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

在制备液体或固体剂型时，可以先将活性组分 A 溶于某些特定的碱性物质，形成苯并异噻唑啉金属盐，合适的碱性物质包括：碱金属碳酸盐、碱金属氢氧化物（如氢氧化钠、氢氧化钾）、碱金属烷氧基碳酸盐、碱金属醇盐或甲醇镁。

本发明的组合物中两种有效成分表现为增效效果，该组合物的活性比使用单个化合物的活性预期总和，以及单个化合物的单独活性更为显著。增效效果表现为允许施用量减少、更宽的杀真菌控制谱、见效快、更持久的防治效果、通过仅仅一次或少数几次施用更好的控制植物有害真菌、以及加宽了可能的施用间隔时间。这些特性是植物真菌控制实践过程中特别需要的。

本发明的杀菌剂组合物可应用于农业领域防治农作物病害方面，所针对的具体病症包括但不限于小麦病害(如：小麦赤霉病、小麦白粉病、小麦锈病等)、水稻病害（如：水稻纹枯病、水稻稻曲病、水稻稻瘟病、水稻细菌性条斑等）、玉米病害(如：玉米黑穗病、玉米大斑病、玉米小斑病)、黄瓜病害（如：黄瓜霜霉病、黄瓜白粉病、黄瓜炭疽病、黄瓜细菌性角斑病等）、番茄病害（如：番茄炭疽病、番茄灰霉病、番茄细菌性角斑病等）、葡萄病害（如：葡萄霜霉病、葡萄灰霉病、葡萄白粉病）、苹果病害（如苹果轮纹病、苹果炭疽病等）、柑橘病害（柑橘溃疡病、柑橘疮痂并、柑橘炭疽病）、烟草病害（烟草野火病）等。

本发明的杀菌组合物的表现出的其它特点主要表现为：1、本发明的组合物混配具有明显的增效作用；2、由于本组合物的两个单剂化学结构差异很大，作用机理完全不同，不存在交互抗性，可延缓两单剂单独使用所产生的抗性；3、本发明的组合物对作物安全、防效好。经试验证明，本发明杀菌剂组合物化学性质稳定，增效显著，对防治对象表现出明显的增效以及互补作用。

具体实施方式

为了使本发明的目的、技术方案及优点更加清楚明白，以下结合实施例，对本发明进行进一步详细说明。应当理解，此处所描述的具体实施例仅用以解释本发明，并不用于限定本发明，凡在本发明的精神和原则之内所做的任何修改、等同替换和改进等，均应包含在本发明的保护范围之内。

以下实施例所有配方中百分比均为重量百分比。本发明组合物各种制剂的加工工艺均为现有技术，根据不同情况可以有所变化。

一、剂型制备实施例

(一) 水分散粒剂的加工及实施例

将活性成分活性分组 A 与活性组分 B，与助剂和填料按配方的比例混合均匀，经气流粉碎成可湿性粉剂，再加入一定量的水混合挤压造粒，经干燥筛分后制得水分散粒剂产品。

(1) 活性组分 A (BIT) 与极细链格孢激活蛋白制备水分散粒剂

实施例 1: 31%BIT · 极细链格孢激活蛋白水分散粒剂

BIT 30%，极细链格孢激活蛋白 1%，黄原胶 2%，脂肪酰胺 N-甲基牛磺酸钠盐 3%，硫酸铵 5%，白炭黑补足至 100%

实施例 2: 31.5% BIT · 极细链格孢激活蛋白水分散粒剂

BIT 1.5%，极细链格孢激活蛋白 30%，膨润土 8%，木质素磺酸钙盐 6%，硫酸铵 5%，高岭土补足至 100%

(2) 活性组分 A (MBIT) 与极细链格孢激活蛋白制备水分散粒剂

实施例 3: 31%MBIT · 极细链格孢激活蛋白水分散粒剂

MBIT 30%，极细链格孢激活蛋白 1%，其余组分按照实施例 1 的方法制备。

实施例 4: 31.5% MBIT · 极细链格孢激活蛋白水分散粒剂

MBIT 1.5%，极细链格孢激活蛋白 30%，其余组分按照实施例 2 的方法制备。

(3) 活性组分 A (BBIT) 与极细链格孢激活蛋白制备水分散粒剂

实施例 5: 31%BBIT · 极细链格孢激活蛋白水分散粒剂

BBIT 30%，极细链格孢激活蛋白 1%，其余组分按照实施例 1 的方法制备。

实施例 6: 31.5% BBIT · 极细链格孢激活蛋白水分散粒剂

BBIT 1.5%，极细链格孢激活蛋白 30%，其余组分按照实施例 2 的方法制备。

(二) 悬浮剂的加工及实施例

将活性成分活性分组 A 与活性组分 B，与分散剂、润湿剂、增稠剂和水等各组分配方的比例混合均匀，经砂磨和/或高速剪切后，得到半成品，分析后补加水混合均匀过滤即得成品。

(1) 活性组分 A (BIT) 与极细链格孢激活蛋白制备悬浮剂

实施例 7: 10.5% BIT · 极细链格孢激活蛋白悬浮剂

BIT 10%，极细链格孢激活蛋白 0.5%，烷基苯磺酸钠 4%，甲基纤维素 2%，丙二醇 2%，硅油 0.02%，水补足至 100%。

实施例 8: 5%BIT · 极细链格孢激活蛋白悬浮剂

BIT 2.5%, 极细链格孢激活蛋白 2.5%, 烷基酚聚氧乙烯醚 4%, 黄原胶 3%, 丙三醇 3%, 硅油 0.01%, 水补足至 100%。

实施例 9: 33%BIT · 极细链格孢激活蛋白悬浮剂

BIT 3%, 极细链格孢激活蛋白 30%, 烷基酚聚氧乙烯醚硫酸盐 10%, 聚乙烯醇 8%, 乙二醇 10%, 硅油 0.05%, 水补足至 100%。

(2) 活性组分 A (MBIT) 与极细链格孢激活蛋白制备悬浮剂

实施例 10: 10.5%MBIT · 极细链格孢激活蛋白悬浮剂

MBIT 10%, 极细链格孢激活蛋白 0.5%, 其余组分按照实施例 7 的方法制备。

实施例 11: 5%MBIT · 极细链格孢激活蛋白悬浮剂

MBIT 2.5%, 极细链格孢激活蛋白 2.5%, 其余组分按照实施例 8 的方法制备。

实施例 12: 33%MBIT · 极细链格孢激活蛋白悬浮剂

MBIT 3%, 极细链格孢激活蛋白 30%, 其余组分按照实施例 9 的方法制备。

(3) 活性组分 A (BBIT) 与极细链格孢激活蛋白制备悬浮剂

实施例 13: 10.5%BBIT · 极细链格孢激活蛋白悬浮剂

BBIT 10%, 极细链格孢激活蛋白 0.5%, 其余组分按照实施例 7 的方法制备。

实施例 14: 5%BBIT · 极细链格孢激活蛋白悬浮剂

BBIT 2.5%, 极细链格孢激活蛋白 2.5%, 其余组分按照实施例 8 的方法制备。

实施例 15: 33%BBIT · 极细链格孢激活蛋白悬浮剂

BBIT 3%, 极细链格孢激活蛋白 30%, 其余组分按照实施例 9 的方法制备。

(三) 可湿性粉剂的加工及实施例

将活性成分 A 与 B 活性成分与各种助剂及填料等按比例充分混合, 经超细粉碎机粉碎后制得可湿性粉剂。

(1) 活性组分 A (BIT) 与极细链格孢激活蛋白制备可湿性粉剂

实施例 16: 3.3%BIT · 极细链格孢激活蛋白可湿性粉剂

BIT 3%, 极细链格孢激活蛋白 0.3%, 聚氧乙烯三苯乙烯苯基磷酸盐 2%, 木质素磺酸钠 2%, 分子筛 2%, 高岭土补足至 100%。

实施例 17: 30%BIT · 极细链格孢激活蛋白可湿性粉剂

BIT 1%, 极细链格孢激活蛋白 30%, 十二烷基硫酸钠 10%, 烷基酚聚氧乙烯醚 8%, 尿素 8%, 凹凸棒土补足至 100%。

(2) 活性组分 A (MBIT) 与极细链格孢激活蛋白制备可湿性粉剂

实施例 18: 3.3%MBIT · 极细链格孢激活蛋白可湿性粉剂

MBIT 3%, 极细链格孢激活蛋白 0.3%, 其余组分按照实施例 16 的方法制备。

实施例 19: 31%MBIT · 极细链格孢激活蛋白可湿性粉剂

MBIT 1%, 极细链格孢激活蛋白 30%, 其余组分按照实施例 17 的方法制备。

(3) 活性组分 A (BBIT) 与极细链格孢激活蛋白制备可湿性粉剂

实施例 20: 3.3%BBIT · 极细链格孢激活蛋白可湿性粉剂

BBIT 3%, 极细链格孢激活蛋白 0.3%, 其余组分按照实施例 16 的方法制备。

实施例 21: 31%BBIT · 极细链格孢激活蛋白可湿性粉剂

BBIT 1%, 极细链格孢激活蛋白 30%, 其余组分按照实施例 17 的方法制备。

二、药效验证试验

(一) 生物测定实施例

按照试验分级标准调查整株叶片的发病情况, 计算病情指数和防治效果。

将防治效果换算成几率值 (y), 药液浓度 ($\mu\text{g/ml}$) 转换成对数值 (x), 以最小二乘法计算毒力方程和抑制中浓度 EC50, 依孙云沛法计算药剂的毒力指数及共毒系数 (CTC)。

实测毒力指数 (ATI) = (标准药剂 EC50 / 供试药剂 EC50) * 100

理论毒力指数 (TTI) = A 药剂毒力指数 * 混剂中 A 的百分含量 + B 药剂毒力指数 * 混剂中 B 的百分含量

共毒系数 (CTC) = [混剂实测毒力指数 (ATI) / 混剂理论毒力指数 (TTI)] * 100

CTC ≤ 80, 组合物表现为拮抗作用, 80 < CTC < 120, 组合物表现为相加作用, CTC ≥ 120, 组合物表现为增效作用。

1、BIT 与极细链格孢激活蛋白复配对番茄菌核病毒力测定试验

表 1. BIT 与极细链格孢激活蛋白复配对番茄菌核病毒力测定结果分析

药剂名称	EC ₅₀ ($\mu\text{g/ml}$)	ATI	TTI	共毒系数 (CTC)
BIT	16.53	100.00	\	\
极细链格孢激活蛋白	17.87	92.50	\	\
BIT: 极细链格孢激活蛋白=30:1	13.20	125.27	99.76	125.57
BIT: 极细链格孢激活蛋白=20:1	12.31	134.24	99.64	134.72
BIT: 极细链格孢激活蛋白=10:1	11.38	145.26	99.32	146.26
BIT: 极细链格孢激活蛋白=5:1	8.94	184.87	98.75	187.21
BIT: 极细链格孢激活蛋白=1:1	9.96	165.89	96.25	172.35
BIT: 极细链格孢激活蛋白=1:5	11.14	148.38	93.75	158.27
BIT: 极细链格孢激活蛋白=1:10	12.49	132.37	93.18	142.06
BIT: 极细链格孢激活蛋白=1:20	13.76	120.15	92.86	129.39
BIT: 极细链格孢激活蛋白=1:30	14.66	112.77	92.74	121.60

结果（表 1）表明，BIT 与极细链格孢激活蛋白复配对番茄菌核病的防治效果显著提高，说明二者复配对番茄菌核病防治有显著的增效作用。

2、MBIT 与极细链格孢激活蛋白复配对猕猴桃溃疡病毒力测定试验

表 2. MBIT 与极细链格孢激活蛋白复配对猕猴桃溃疡病毒力测定结果分析

药剂名称	EC ₅₀ (μg/ml)	ATI	TTI	共毒系数 (CTC)
MBIT	9.88	100.00	\	\
极细链格孢激活蛋白	9.26	106.70	\	\
MBIT: 极细链格孢激活蛋白=30:1	8.02	123.14	100.22	122.87
MBIT: 极细链格孢激活蛋白=20:1	7.72	128.03	100.32	127.62
MBIT: 极细链格孢激活蛋白=10:1	7.41	133.40	100.61	132.59
MBIT: 极细链格孢激活蛋白=5:1	6.47	152.80	101.12	151.11
MBIT: 极细链格孢激活蛋白=1:1	5.78	170.83	103.35	165.29
MBIT: 极细链格孢激活蛋白=1:5	4.87	203.05	105.58	192.31
MBIT: 极细链格孢激活蛋白=1:10	5.64	175.26	106.09	165.20
MBIT: 极细链格孢激活蛋白=1:20	7.02	140.69	106.38	132.25
MBIT: 极细链格孢激活蛋白=1:30	7.35	134.51	106.48	126.32

结果（表 2）表明，MBIT 与极细链格孢激活蛋白复配对猕猴桃溃疡病的防治效果显著提高，说明二者复配对猕猴桃溃疡病防治有显著的增效作用。

3、BBIT 与极细链格孢激活蛋白对西瓜细菌性角斑病毒力测定试验

表 3. BBIT 与极细链格孢激活蛋白复配对西瓜细菌性角斑病毒力测定结果分析

药剂名称	EC ₅₀ (μg/ml)	ATI	TTI	共毒系数 (CTC)
BBIT	12.24	100.00	\	\
极细链格孢激活蛋白	14.27	85.77	\	\
BBIT: 极细链格孢激活蛋白=30:1	9.77	125.29	99.54	125.87
BBIT: 极细链格孢激活蛋白=20:1	8.96	136.63	99.32	137.56
BBIT: 极细链格孢激活蛋白=10:1	8.37	146.29	98.71	148.21
BBIT: 极细链格孢激活蛋白=5:1	7.77	157.46	97.63	161.29
BBIT: 极细链格孢激活蛋白=1:1	8.58	142.61	92.89	153.53
BBIT: 极细链格孢激活蛋白=1:5	9.54	128.35	88.14	145.62
BBIT: 极细链格孢激活蛋白=1:10	10.17	120.32	87.06	138.20
BBIT: 极细链格孢激活蛋白=1:20	10.92	112.10	86.45	129.67
BBIT: 极细链格孢激活蛋白=1:30	11.40	107.41	86.23	124.56

结果（表 3）表明，BBIT 与极细链格孢激活蛋白复配对西瓜细菌性角斑病的防治效果显著提高，说明二者复配对西瓜细菌性角斑病防治有显著的增效作用。

（二）田间药效验证试验

试验方法：在发病初期，立即进行第一次喷雾，7 天后进行第二次施药，每个处理 4 个小区，每个小区 20 平米。于药前和第二次药后 11 天调查统计发病情况，每个小区 5 点随机

取样, 每点调查 5 株作物, 调查整株上每叶片的病斑面积占叶片面积的百分率并分级, 计算病情指数和防治效果。

$$\text{病情指数} = \frac{\sum(\text{各级叶片发病数} \times \text{该级代表值})}{\text{调查总叶片数} \times \text{最高级代表值}} \times 100$$

$$\text{防治效果}(\%) = \left(1 - \frac{\text{药前对照病情指数} \times \text{药后处理病情指数}}{\text{药后对照病情指数} \times \text{药前处理病情指数}}\right) \times 100$$

$$\text{预期防效}(\%) = X + Y - XY/100 \quad (\text{其中, } X, Y \text{ 为单剂防效})$$

分级标准:

0 级: 无病斑;

1 级: 叶片病斑少于 5 个, 长度小于 1cm;

3 级: 叶片病斑 6-10 个, 部分病斑长度大于 1cm;

5 级: 叶片病斑 11-25 个, 部分病斑连成片, 病斑面积占叶面积的 10-25%;

7 级: 叶片病斑 26 个以上, 病斑连成片, 病斑面积占叶面积的 26-50%;

9 级: 病斑连成片, 病斑面积占叶面积的 50%以上或全叶枯死。

1、BIT 与极细链格孢激活蛋白复配田间药效实验

表 4 BIT 与极细链格孢激活蛋白混配对小麦纹枯病防治效果

序号	处理药剂	用量 (a.i. g/ha)	药前病情 指数	第二次药后 11 天	
				病情 指数	防效(%)
实施例 1	3%BIT 水分散粒剂	43.55	11.19	9.17	69.01
	3%极细链格孢激活蛋白水分散粒剂	1.45	12.34	32.15	1.52
	两者混合后预期防效	—	—	—	69.48
	31%BIT·极细链格孢激活蛋白水分散粒剂 (BIT: 极细链格孢激活蛋白=30:1)	45.00	13.98	5.28	85.72
实施例 2	3%BIT 水分散粒剂	2.14	15.26	38.84	3.78
	3%极细链格孢激活蛋白水分散粒剂	42.86	14.26	14.61	61.27
	两者混合后预期防效	—	—	—	62.73
	31.5%BIT·极细链格孢激活蛋白水分散粒剂 (BIT: 极细链格孢激活蛋白=1:20)	45.00	11.72	7.89	74.56
实施例 7	5%BIT 悬浮剂	42.86	12.38	10.51	67.92
	20%极细链格孢激活蛋白悬浮剂	2.14	8.97	23.13	2.52
	两者混合后预期防效	—	—	—	68.73
	10.5%BIT·极细链格孢激活蛋白悬浮剂 (BIT: 极细链格孢激活蛋白=20:1)	45.00	10.47	7.24	73.87
实施例 8	3%BIT 悬浮剂	22.50	12.52	21.25	35.85
	20%极细链格孢激活蛋白悬浮剂	22.50	11.05	19.91	31.89
	两者混合后预期防效	—	—	—	56.31
	5%BIT·极细链格孢激活蛋白悬浮剂 (BIT: 极细链格孢激活蛋白=1:1)	45.00	12.63	5.29	84.16

实施例 9	3%BIT 悬浮剂	4.09	11.51	28.36	6.85
	20%极细链格孢激活蛋白悬浮剂	40.91	13.27	14.58	58.46
	两者混合后预期防效	—	—	—	61.30
	33%BIT·极细链格孢激活蛋白悬浮剂 (BIT: 极细链格孢激活蛋白=1:10)	45.00	10.93	6.35	78.03
实施例 16	5%BIT 可湿性粉剂	40.91	12.41	11.54	64.85
	3%极细链格孢激活蛋白可湿性粉剂	4.09	10.73	26.87	5.33
	两者混合后预期防效	—	—	—	66.72
	3.3%BIT·极细链格孢激活蛋白可湿性粉剂 (BIT: 极细链格孢激活蛋白=10: 1)	45.00	11.52	6.64	78.21
实施例 17	5%BIT 可湿性粉剂	1.45	13.29	34.21	2.69
	3%极细链格孢激活蛋白可湿性粉剂	43.55	9.20	9.18	62.27
	两者混合后预期防效	—	—	—	63.28
	31%BIT·极细链格孢激活蛋白可湿性粉剂 (BIT: 极细链格孢激活蛋白=1: 30)	45.00	10.56	4.90	82.45
CK	清水对照	—	12.63	33.41	—

测定结果(表 4)表明, BIT 与极细链格孢激活蛋白的复配对小麦纹枯病防效明显提高, 说明二者复配对小麦纹枯病有显著的增效作用。

2、MBIT 与极细链格孢激活蛋白复配田间药效实验

表 5 MBIT 与极细链格孢激活蛋白混配对豇豆细菌性叶斑病防治效果

序号	处理药剂	用量 (a.i. g/ha)	药前病 情指数	第二次药后 11 天	
				病情 指数	防效(%)
实施例 3	3%MBIT 水分散粒剂	34.84	10.66	13.07	60.68
	3%极细链格孢激活蛋白水分散粒剂	1.16	10.74	32.12	4.08
	两者混合后预期防效	—	—	—	62.25
	31%MBIT·极细链格孢激活蛋白水分散粒剂 (MBIT: 极细链格孢激活蛋白=30:1)	36.00	11.43	6.31	82.28
实施例 4	3%MBIT 水分散粒剂	1.71	12.05	36.34	3.27
	3%极细链格孢激活蛋白水分散粒剂	34.29	11.42	10.94	69.28
	两者混合后预期防效	—	—	—	70.28
	31.5%MBIT·极细链格孢激活蛋白水分散粒剂 (MBIT: 极细链格孢激活蛋白=1:20)	36.00	10.77	8.85	73.65
实施例 10	5%MBIT 悬浮剂	34.29	10.32	12.96	59.73
	20%极细链格孢激活蛋白悬浮剂	1.71	10.63	31.43	5.16
	两者混合后预期防效	—	—	—	61.81
	10.5%MBIT·极细链格孢激活蛋白悬浮剂 (MBIT: 极细链格孢激活蛋白=20:1)	36.00	11.05	8.95	74.02
实施例 11	3%MBIT 悬浮剂	18.00	11.32	24.17	31.50
	20%极细链格孢激活蛋白悬浮剂	18.00	10.05	19.67	37.22

	两者混合后预期防效	—	—	—	57.00
	5%MBIT·极细链格孢激活蛋白悬浮剂 (MBIT: 极细链格孢激活蛋白=1:1)	36.00	10.42	5.29	83.72
实施例 12	3%MBIT 悬浮剂	3.27	8.96	26.27	5.97
	20%极细链格孢激活蛋白悬浮剂	32.73	9.73	10.25	66.21
	两者混合后预期防效	—	—	—	68.23
	33%MBIT·极细链格孢激活蛋白悬浮剂 (MBIT: 极细链格孢激活蛋白=1:10)	36.00	10.59	7.27	77.98
实施例 18	5%MBIT 可湿性粉剂	32.73	10.74	14.39	57.03
	3%极细链格孢激活蛋白可湿性粉剂	3.27	11.42	32.67	8.23
	两者混合后预期防效	—	—	—	60.56
	3.3%MBIT·极细链格孢激活蛋白可湿性粉剂 (MBIT: 极细链格孢激活蛋白=10: 1)	36.00	10.52	7.33	77.64
实施例 19	5%MBIT 可湿性粉剂	1.16	10.04	30.58	2.32
	3%极细链格孢激活蛋白可湿性粉剂	34.84	9.83	9.08	70.36
	两者混合后预期防效	—	—	—	70.99
	31%MBIT·极细链格孢激活蛋白可湿性粉剂 (MBIT: 极细链格孢激活蛋白=1: 30)	36.00	9.76	4.14	86.41
CK	清水对照	—	10.54	32.86	—

测定结果(表 5)表明, MBIT 与极细链格孢激活蛋白混配对豇豆细菌性叶斑病的防效明显提高, 说明二者复配对豇豆细菌性叶斑病有显著的增效作用。

3、BBIT 与极细链格孢激活蛋白复配田间药效实验

表 6 BBIT 与极细链格孢激活蛋白混配对葡萄黑痘病防治效果

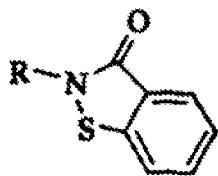
序号	处理药剂	用量 (a.i. mg/kg)	药前病 情指数	第二次药后 11 天	
				病情 指数	防效(%)
实施例 5	3%BBIT 水分散粒剂	61.90	15.32	11.28	71.43
	3%极细链格孢激活蛋白水分散粒剂	2.10	14.72	37.19	1.92
	两者混合后预期防效	—	—	—	71.98
	31%BBIT·极细链格孢激活蛋白水分散粒剂 (BBIT: 极细链格孢激活蛋白=30:1)	64.00	15.62	4.04	89.97
实施例 6	3%BBIT 水分散粒剂	3.05	14.72	35.88	5.37
	3%极细链格孢激活蛋白水分散粒剂	60.95	15.41	16.11	59.42
	两者混合后预期防效	—	—	—	61.60

	31.5%BBIT·极细链格孢激活蛋白水分散粒剂 (BBIT: 极细链格孢激活蛋白=1:20)	64.00	14.72	8.79	76.82
实施例 13	5%BBIT 悬浮剂	60.95	15.21	11.61	70.36
	20%极细链格孢激活蛋白悬浮剂	3.05	14.29	35.76	2.85
	两者混合后预期防效	—	—	—	71.20
	10.5%BBIT·极细链格孢激活蛋白悬浮剂 (BBIT: 极细链格孢激活蛋白=20:1)	64.00	15.62	9.44	76.53
实施例 14	3%BBIT 悬浮剂	32.00	13.99	22.39	37.86
	20%极细链格孢激活蛋白悬浮剂	32.00	14.82	26.29	31.13
	两者混合后预期防效	—	—	—	57.21
	5%BBIT·极细链格孢激活蛋白悬浮剂 (BBIT: 极细链格孢激活蛋白=1:1)	64.00	15.20	4.72	87.94
实施例 15	3%BBIT 悬浮剂	5.82	15.36	36.21	8.48
	20%极细链格孢激活蛋白悬浮剂	58.18	14.26	15.90	56.71
	两者混合后预期防效	—	—	—	60.38
	33%BBIT·极细链格孢激活蛋白悬浮剂 (BBIT: 极细链格孢激活蛋白=1:10)	64.00	15.21	7.86	79.94
实施例 20	5%BBIT 可湿性粉剂	58.18	14.82	12.50	67.25
	3%极细链格孢激活蛋白可湿性粉剂	5.82	14.52	35.32	5.56
	两者混合后预期防效	—	—	—	69.07
	3.3%BBIT·极细链格孢激活蛋白可湿性粉剂 (BBIT: 极细链格孢激活蛋白=10: 1)	64.00	13.56	6.94	80.12
实施例 21	5%BBIT 可湿性粉剂	2.10	14.78	36.43	4.30
	3%极细链格孢激活蛋白可湿性粉剂	61.90	15.29	15.62	60.35
	两者混合后预期防效	—	—	—	62.05
	31%BBIT·极细链格孢激活蛋白可湿性粉剂 (BBIT: 极细链格孢激活蛋白=1: 30)	64.00	14.87	6.03	84.26
CK	清水对照	—	15.02	38.69	—

测定结果(表 6)表明, BBIT 与极细链格孢激活蛋白混配对葡萄黑痘病的防效明显提高, 说明二者复配对葡萄黑痘病有显著的增效作用。

权 利 要 求 书

1. 一种杀菌剂组合物，其特征在于所述的组合物包含 A 和 B 两种活性组分，其中活性组分 A 为具有式 (I) 的结构化合物，活性组分 B 为极细链格孢激活蛋白，两组分之间的重量比为 30~1: 1~30，



式 (I)

式 (I) 中，R 选自 H 或 $C_1 \sim C_8$ 烷基。

2. 根据权利要求 1 所述的杀菌剂组合物，其特征在于式 (I) 中，R 选自 H 或 $C_1 \sim C_4$ 烷基。
3. 根据权利要求 1 所述的杀菌剂组合物，其特征在于式 (I) 中，R 优先选自 H、 $-CH_3$ 或 $-C_4H_9$ ，对应的活性组分 A 分别为 1,2-苯并异噻唑啉-3-酮、2-甲基-1,2-苯并异噻唑啉-3-酮或 2-丁基-1,2-苯并异噻唑啉-3-酮。
4. 根据权利要求 1 所述的杀菌剂组合物，其特征在于活性组分 A 和活性组分 B 的重量比为 20~1: 1~20。
5. 根据权利要求 1~4 中任意一项所述的杀菌剂组合物，其特征在于该组合物由活性成分和农药助剂或辅料制成农药上允许的剂型。
6. 根据权利要求 5 所述的杀菌剂组合物，其特征在于所述的剂型为可湿性粉剂、悬浮剂或水分散粒剂。
7. 根据权利要求 5 或 6 所述的杀菌剂组合物，其特征在于所述农药助剂或辅料选自载体、溶剂、分散剂、润湿剂、胶粘剂、增稠剂、粘合剂、表面活性剂或肥料中的一种或几种。
8. 权利要求 1~7 中任意一项所述的杀菌剂组合物在农业领域防治农作物病害方面的用途。