

[19] 中华人民共和国国家知识产权局



[12] 发明专利申请公布说明书

[21] 申请号 200680047466.0

[51] Int. Cl.

A01N 37/50 (2006.01)

A01N 47/04 (2006.01)

A01P 3/00 (2006.01)

[43] 公开日 2008年12月24日

[11] 公开号 CN 101330827A

[22] 申请日 2006.12.4

[21] 申请号 200680047466.0

[30] 优先权

[32] 2005.12.16 [33] DE [31] 102005060281.9

[86] 国际申请 PCT/EP2006/011605 2006.12.4

[87] 国际公布 WO2007/068367 英 2007.6.21

[85] 进入国家阶段日期 2008.6.16

[71] 申请人 拜尔农作物科学股份公司

地址 德国蒙海姆

[72] 发明人 I·豪斯尔-哈恩 P·丹门

A·威森伯格

U·威辰道福-诺伊曼

[74] 专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司

代理人 钟守期 唐铁军

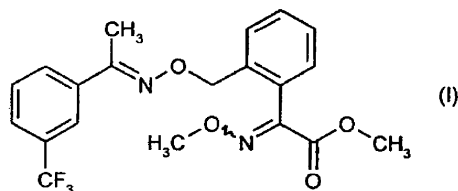
权利要求书2页 说明书27页

[54] 发明名称

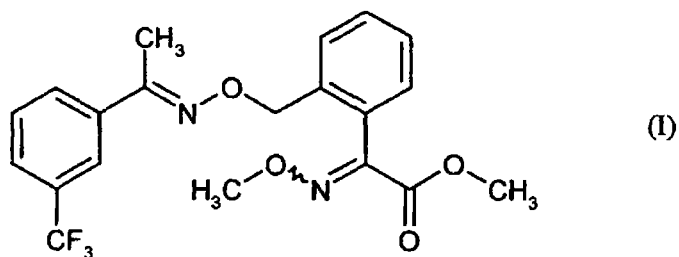
杀菌活性化合物结合物

[57] 摘要

描述了含有式(I)的脲醚衍生物和克菌丹的活性化合物结合物及其作为杀菌剂的用途。

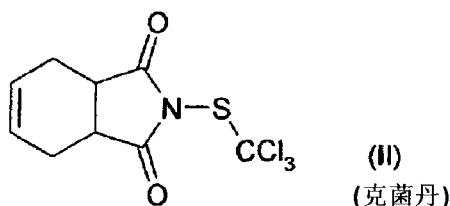


1. 活性化合物结合物，含有式 (I) 的一种化合物



和

(2) 式 (II) 的一种化合物



2. 根据权利要求 1 的活性化合物结合物，其特征在于所述活性化合物结合物中式 (I) 活性化合物与式 (II) 活性化合物的重量比为 1:10 至 1:19。

3. 根据权利要求 1 或 2 的活性化合物结合物，其特征在于所述活性化合物结合物中式 (I) 活性化合物与式 (II) 活性化合物的重量比为 1:12 至 1:18。

4. 根据权利要求 1-3 的任一项的活性化合物结合物，其特征在于所述活性化合物结合物中式 (I) 活性化合物与式 (II) 活性化合物的重量比为 1:14 至 1:16。

5. 防治植物致病真菌的方法，其特征在于使权利要求 1-4 的任一项的活性化合物结合物作用于真菌和/或其生境或者植物、植物部位、种子、土壤、地区、材料或空间，以使其不受植物致病真菌的侵染。

6. 根据权利要求 5 的方法，其特征在于权利要求 1 的化合物 (I) 和权利要求 1 的化合物 (II) 同时施用或相继地施用，所述同时施用即一起或分别地施用。

7. 繁殖材料，涂敷有权利要求 1-4 的一项或多项中的活性化合物结合物。

8. 杀菌剂组合物，含有一定量的权利要求 1-4 的一项或多项中所定义的活性化合物结合物。

9. 权利要求 1-4 和 8 的一项或多项中所定义的活性化合物结合物或组合物的用于防治真菌的用途。

10. 制备杀菌组合物的方法, 其特征在于将权利要求 1-4 的一项或多项的活性化合物结合物中的活性化合物与填充剂和/或表面活性剂混合。

杀菌活性化合物结合物

本发明涉及一种含有已知的脞醚衍生物和已知的二硫代氨基甲酸酯并高度适合于防治植物致病真菌的新型活性化合物结合物。

已知通用名为脞菌酯 (trifloxystrobin) 的脞衍生物 2-[α -{[(α -甲基-3-三氟甲基-苯甲基)亚氨基]-氧}-邻甲苯基]-二羧乙酸甲酯 0-甲基脞具有杀菌特性(参见 EP-A-0 460 575)。该化合物的活性良好;但是,其在低施用率时有时并不令人满意。该化合物的制备同样已知于 EP-A-0 460 575。

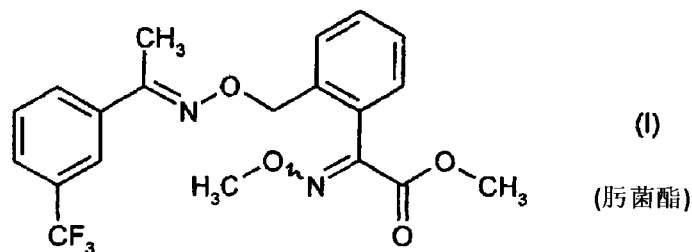
此外,已知通用名为克菌丹(captan)的邻苯二甲酰亚胺 3a, 4, 7, 7a-四氢-2-[(三氟甲基)硫]-1H-异吡啶-1, 3(2H)-二酮具有杀菌特性(参见 US 2553770)。该化合物的活性良好;但是,其在低施用率时有时并不令人满意。该化合物的制备同样是已知的。

此外,已知脞菌酯通常可与多种杀菌剂相结合(例如 WO 97/00012、WO 97/00013)。在较长的名录中,其中一个被提及的可能的混合组分为丙森锌(propineb)(Research Disclosure 41512 1998, 1437-1439 页)。

由于对当今的杀菌剂在环境和经济方面的要求在不断提高,例如,对于其作用谱、毒性、选择性、施用率、残留物的形成,以及良好的制备性等方面的要求,并且由于还可能存在例如抗性方面的问题,因此开发至少在某些方面优于其已知相应物的新的杀菌剂是一项持久的任务。

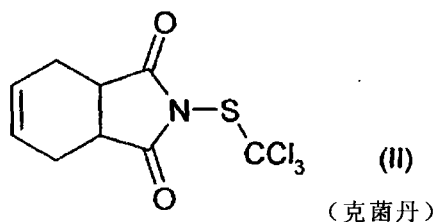
本发明提供至少在某些方面能达到所述目标的活性化合物结合物。

已发现含有式(I)的 2-[α -{[(α -甲基-3-三氟甲基-苯甲基)亚氨基]氧}-邻甲苯基]-二羧乙酸甲酯 0-甲基脞



和

(2) 式 (II) 的 3a, 4, 7, 7a-四氢-2-[(三氯甲基)硫]-1H-异吲哚-1, 3(2H)-二酮 (参见: US 2553770)



的新型活性化合物结合物具有良好的杀菌特性。

令人惊讶的是本发明活性化合物结合物的杀菌活性显著高于单个活性化合物的活性的总和。换言之, 存在预料不到的真实的协同效应, 而并非仅仅是活性的增补。

当活性化合物以某些重量比存在于本发明活性化合物结合物中时, 协同效应特别明显。但是, 活性化合物结合物中活性化合物的重量比可在一定范围内变化。

优选的混合比为其中脲菌酯和克菌丹以 1:10 至 1:19 的比例存在的混合比。

进一步优选的混合比为其中脲菌酯和克菌丹以 1:11 至 1:18 的比例存在的混合比。

特别优选的混合比为其中脲菌酯和克菌丹以 1:12 至 1:18 的比例存在的混合比。

极特别优选的混合比为其中脲菌酯和克菌丹以 1:13 至 1:17 的比例存在的混合比。

进一步极特别优选的混合比为其中脲菌酯和克菌丹以 1:13 至 1:16 的比例存在的混合比。

更进一步极特别优选的混合比为其中脲菌酯和克菌丹以 1:14 至 1:16 的比例存在的混合比。

在一个极特别优选的混合比中，脲菌酯和克菌丹以 1:15 的比例存在。

所述活性化合物脲菌酯和克菌丹可商购获得。关于采购和—如果合适—合成的信息可在 C. D. S. Tomlin, *The Pesticide Manual*, 第 13 版, British Crop Protection Council, Farnham 2003 及其中所引文献中找到。式 (I) 的活性化合物是已知的 (例如参见 EP-A-460 575)。

从式 (I) 的活性化合物的结构式可以看出, 化合物可作为 E 或 Z 异构体存在。因此, 化合物 (I) 可以不同异构体的混合物或以单个异构体的形式存在。优选以 E 异构体形式存在的式 (I) 的化合物。

本发明的活性化合物结合物具有有效的杀微生物活性并可在作物保护中和在材料保护中用于防治不良微生物, 例如真菌和细菌。

杀真菌剂可在作物保护中用于防治根肿菌 (Plasmodiophoromycetes)、卵菌 (Oomycetes)、壶菌 (Chytridiomycetes)、接合菌 (Zygomycetes)、子囊菌 (Ascomycetes)、担子菌 (Basidiomycetes) 及半知菌 (Deuteromycetes)。

杀细菌剂可在作物保护中用于防治假单胞菌 (Pseudomonadaceae)、根瘤菌 (Rhizobiaceae)、肠杆菌 (Enterobacteriaceae)、棒杆菌 (Corynebacteriaceae) 以及链霉菌 (Streptomyetaceae)。

本发明的活性化合物结合物具有非常良好的杀真菌特性并且可用于防治植物致病真菌, 例如根肿菌、卵菌、壶菌、接合菌、子囊菌、担子菌、半知菌等。

可作为实例但非限制性地提及的归入以上所列属名的导致真菌病害和细菌病害的一些病原体如下:

由白粉病病原体引起的病害, 所述病原体例如

布氏白粉菌属 (*Blumeria*) 菌种, 例如禾本科布氏白粉菌 (*Blumeria graminis*);

叉丝单囊壳属 (*Podosphaera*) 菌种, 例如白叉丝单囊壳 (*Podosphaera leucotricha*);

单囊壳属 (*Sphaerotheca*) 菌种, 例如凤仙花单囊壳 (*Sphaerotheca fuliginea*);

钩丝壳属(*Uncinula*)菌种,例如葡萄钩丝壳(*Uncinula necator*);

由锈病病原体引起的病害,所述病原体例如

胶锈菌属(*Gymnosporangium*)菌种,例如 *Gymnosporangium sabinae*;

驼孢锈属(*Hemileia*)菌种,例如咖啡驼孢锈菌(*Hemileia vastatrix*);

层锈菌(*Phakopsora*)菌种,例如豆薯层锈菌(*Phakopsora pachyrhizi*)和山马蝗层菌(*Phakopsora meibomiae*);

柄锈菌(*Puccinia*)菌种,例如隐匿柄锈菌(*Puccinia recondita*);

单胞锈菌属(*Uromyces*)菌种,例如疣顶单胞锈菌(*Uromyces appendiculatus*);

由卵菌纲(*Oomycetene*)类病原体引起的病害,所述病原体例如

盘霜霉(*Bremia*)菌种,例如莴苣盘霜霉(*Bremia lactucae*);

霜霉(*Peronospora*)菌种,例如豌豆霜霉(*Peronospora pisi*)或十字花科霜霉(*P. brassicae*);

疫霉(*Phytophthora*)菌种,例如致病疫霉(*Phytophthora infestans*);

轴霜霉(*Plasmopara*)菌种,例如葡萄生轴霜霉(*Plasmopara viticola*);

假霜霉(*Pseudoperonospora*)菌种,例如草假霜霉(*Pseudoperonospora humuli*)或古巴假霜霉(*Pseudoperonospora cubensis*);

腐霉(*Pythium*)菌种,例如终极腐霉(*Pythium ultimum*);

由例如以下病原体引起的叶斑枯病和叶萎蔫病病害,

链格孢属(*Alternaria*)菌种,例如早疫病链格孢(*Alternaria solani*);

尾孢属(*Cercospora*)菌种,例如恭菜生尾孢(*Cercospora beticola*);

Cladosporium 菌种, 例如 *Cladosporium cucumerinum*;
旋孢腔菌属(*Cochliobolus*)菌种, 例如禾旋孢腔菌(*Cochliobolus sativus*)
(分生孢子形式: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);
炭疽菌属(*Colletotrichum*)菌种, 例如 *Colletotrichum lindemuthianum*;
Cycloconium 菌种, 例如 *Cycloconium oleaginum*;
间座壳属(*Diaporthe*)菌种, 例如柑桔间座壳(*Diaporthe citri*);
痂囊腔菌属(*Elsinoe*)菌种, 例如柑桔痂囊腔菌(*Elsinoe fawcettii*);
盘长孢属(*Gloeosporium*)菌种, 例如悦色盘长孢(*Gloeosporium laeticolor*);
小丛壳属(*Glomerella*)菌种, 例如围小丛壳(*Glomerella cingulata*);
球座菌属(*Guignardia*)菌种, 例如葡萄球座菌(*Guignardia bidwelli*);
小球腔菌属(*Leptosphaeria*)菌种, 例如 *Leptosphaeria maculans*;
Magnaporthe 菌种, 例如 *Magnaporthe grisea*;
球腔菌属(*Mycosphaerella*)菌种, 例如斐济球腔菌(*Mycosphaerella fijiensis*);
Phaeosphaeria 菌种, 例如 *Phaeosphaeria nodorum*;
核腔菌属(*Pyrenophora*)菌种, 例如圆核腔菌(*Pyrenophora teres*);
柱隔孢属(*Ramularia*)菌种, 例如 *Ramularia collo-cygni*;
喙孢属(*Rhynchosporium*)菌种, 例如黑麦喙孢(*Rhynchosporium secalis*);
针孢属(*Septoria*)菌种, 例如芹菜小壳针孢(*Septoria apii*);
核瑚菌属(*Typhula*)菌种, 例如肉孢核瑚菌(*Typhula incarnata*);
黑星菌属(*Venturia*)菌种, 例如苹果黑星病菌(*Venturia inaequalis*);

由例如以下病原体引起的根和茎病害，

Corticium 菌种，例如 *Corticium graminearum*;

镰孢属 (*Fusarium*) 菌种，例如尖镰孢 (*Fusarium oxysporum*);

Gaeumannomyces 菌种，例如 *Gaeumannomyces graminis*;

丝核菌属 (*Rhizoctonia*) 菌种，例如立枯丝核菌 (*Rhizoctonia solani*)。

Tapesia 菌种，例如 *Tapesia acuformis*;

根串珠霉属 (*Thielaviopsis*) 菌种，例如根串珠霉 (*Thielaviopsis basicola*);

由例如以下病原体引起的肉穗花序和散穗花序 (包括玉米穗) 病害，

链格孢属菌种，例如链格孢属种 (*Alternaria* spp.);

曲霉属 (*Aspergillus*) 菌种，例如黄曲霉 (*Aspergillus flavus*);

Cladosporium 菌种，例如 *Cladosporium* spp.;

麦角菌属 (*Claviceps*) 菌种，例如麦角菌 (*Claviceps purpurea*);

镰孢属菌种，例如黄色镰孢 (*Fusarium culmorum*);

赤霉属 (*Gibberella*) 菌种，例如玉蜀黍赤霉 (*Gibberella zeae*);

Monographella 菌种，例如 *Monographella nivalis*;

由黑粉菌引起的病害，所述黑粉菌例如

Sphacelotheca 菌种，例如 *Sphacelotheca reiliana*;

腥黑粉菌属 (*Tilletia*) 菌种，例如小麦网腥黑粉菌 (*Tilletia caries*);

条黑粉菌属 (*Urocystis*) 菌种，例如隐条黑粉菌 (*Urocystis occulta*);

黑粉菌 (*Ustilago*) 菌种，例如裸黑粉菌 (*Ustilago nuda*);

由例如以下病原体引起的果实腐烂，

曲霉属菌种，例如黄曲霉;

葡萄孢属 (*Botrytis*) 菌种, 例如灰葡萄孢 (*Botrytis cinerea*);
青霉菌属 (*Penicillium*) 菌种, 例如扩展青霉 (*Penicillium expansum*);

核盘菌属 (*Sclerotinia*) 菌种, 例如核盘菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*);

Verticilium 菌种, 例如 *Verticilium alboatrum*;

由例如以下病原体引起的种传的和土传的腐烂和萎蔫病害以及幼苗病害,

镰孢属菌种, 例如黄色镰孢;

疫霉菌种, 例如恶疫霉 (*Phytophthora cactorum*);

腐霉菌种, 例如终极腐霉;

丝核菌属菌种, 例如立枯丝核菌;

小菌核属 (*Sclerotium*) 菌种, 例如齐整小核菌 (*Sclerotium rolfsii*);

由例如以下病原体引起的癌性病害、菌瘿和扫帚病,
Nectria 菌种, 例如 *Nectria galligena*;

由例如以下病原体引起的萎蔫病害,

链核盘菌属 (*Monilinia*) 菌种, 例如核果链核盘菌 (*Monilinia laxa*);

由例如以下病原体引起的叶、花和果实的畸形,

外囊菌属 (*Taphrina*) 菌种, 例如桃外囊菌 (*Taphrina deformans*);

由例如以下病原体引起的木本植物的退化病害,

Esca 菌种, 例如 *Phaemoniella clamydospora*;

由例如以下病原体引起的花和种子的病害,

葡萄孢属菌种, 例如灰葡萄孢;

由例如以下病原体引起的植物块茎病害，
丝核菌属菌种，例如立枯丝核菌；

由例如以下细菌病原体引起的病害：

黄单胞菌属 (*Xanthomonas*) 菌种，例如水稻白叶枯病菌 (*Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*)；

假单胞菌 (*Pseudomonas*) 菌种，例如丁香假单胞菌 (*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*)；

欧文氏菌属 (*Erwinia*) 菌种，例如梨火疫病 (*Erwinia amylovora*)；

可优选防治以下大豆病害：

由以下病原体导致的叶、茎、豆荚和种子的真菌病害，例如：

轮纹叶斑病 (*alternaria leaf spot*) (*Alternaria spec. atrans tenuissima*)、炭疽病 (*anthracnose*) (*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*)、褐斑病 (*brown spot*) (大豆褐纹壳针孢 (*Septoria glycines*))、桃叶穿孔病和叶枯病 (*cercospora leaf spot and blight*) (菊池尾孢 (*Cercospora kikuchii*))、*choanephora* 叶枯病 (*Choanephora infundibulifera trispora* (syn.))、*dactuliophora* 叶斑病 (*Dactuliophora glycines*)、霜霉病 (*downy mildew*) (东北霜霉 (*Peronospora manshurica*))、*drechslera blight* (*Drechslera glycini*)、蛙眼病 (*frogeye leaf spot*) (大豆尾孢 (*Cercospora sojae*))、菜豆叶斑病 (*leptosphaerulina leaf spot*) (*Leptosphaerulina trifolii*)、叶点霉叶斑病 (*phyllosticta leaf spot*) (大豆生叶点霉 (*Phyllosticta sojaecola*))、白粉病 (*powdery mildew*) (*Microsphaera diffusa*)、*pyrenochaeta* 叶斑病 (*Pyrenochaeta glycines*)、菌核地上部分枯萎病 (*aerial blight*)、叶枯病及立枯病 (立枯丝核菌)、锈病 (豆薯层锈菌 (*Phakopsora pachyrhizi*))、黑星病 (*scab*) (大豆痂圆孢 (*Sphaceloma glycines*))、*stemphylium* 叶枯病 (匍柄霉 (*Stemphylium botryosum*))、马铃薯早疫病 (*target spot*) (山扁豆生棒孢

(*Corynespora cassiicola*)

由以下病原体引起的根和茎的真菌病害，例如：

黑根腐病 (black root rot) (*Calonectria crotalariae*)、炭腐病 (charcoal rot) (菜豆壳球孢菌 (*Macrophomina phaseolina*))、镰孢枯萎病或萎蔫、根腐以及荚和根颈腐烂 (尖镰孢 (*Fusarium oxysporum*)、直喙镰孢 (*Fusarium orthoceras*)、半裸镰孢 (*Fusarium semitectum*)、木贼镰孢 (*Fusarium equiseti*))、*mycoleptodiscus* 根腐病 (*Mycoleptodiscus terrestris*)、*neocosmospora* (*Neocosmopora vasinfecta*)、荚和茎疫病 (菜豆间座壳 (*Diaporthe phaseolorum*))、茎溃疡 (stem canker) (大豆北方茎溃疡病菌 (*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*))、疫霉腐病 (大雄疫霉 (*Phytophthora megasperma*))、褐颈腐病 (brown stem rot) (大豆茎褐腐病菌 (*Phialophora gregata*))、*pythium* rot (瓜果腐霉 (*Pythium aphanidermatum*)、畸雌腐霉 (*Pythium irregulare*)、德巴利腐霉 (*Pythium debaryanum*)、群结腐霉 (*Pythium myriotylum*)、终极腐霉)、丝核菌根腐病、茎腐和立枯病 (立枯丝核菌)、核盘菌茎腐病 (*Sclerotinia stem decay*) (核盘菌)、核盘菌白绢病 (*sclerotinia southern blight*) (*Sclerotinia rolfisii*)、拟黑根腐病 (*thielaviopsis root rot*) (根串珠霉 (*Thielaviopsis basicola*))。

本发明的活性化合物还在植物中显示出强烈的激发作用。因此，它们适于调动植物的内部防御功能来抵抗不良微生物的侵袭。

在本发明中，植物激发 (抗性诱导) 化合物应被理解为意指这样的物质，它们能够刺激植物的防御系统，使得经处理的植物当其后接种了不良微生物时，对上述微生物表现出显著的抗性。

在本发明中，不良微生物应被理解为植物致病真菌和细菌。因此本发明化合物可用于在处理后的某段时间内保护植物抵抗所述病原体的侵袭。实现该保护作用的时间通常自以活性化合物处理植物起延续 1 至 10 天，优选 1 至 7 天。

本发明活性化合物结合物特别适于防治由曲霉菌/青霉菌等引起

的霉病和叶斑病病害、果实和花腐烂、贮存病害及继发性感染 (secondary infection)。

本发明活性化合物结合物特别适于用在葡萄栽培、水果栽培、作物培植、蔬菜栽培及豆科植物栽培中。

活性化合物结合物在防治植物病害所需浓度下具有良好的植物耐受性的事实使得能够处理植物的地上部位、繁殖材料和种子以及土壤。本发明活性化合物结合物可用于叶敷或拌种。

本发明活性化合物结合物还适于增加采收物产率。此外，它们显示出降低的毒性并具有良好的植物耐受性。

根据本发明，可以处理所有植物及植物部位。此处植物应理解为意指所有的植物及植物种群，例如需要的及不需要的野生植物或作物植物（包括自然存在的作物植物）。作物植物可以是可通过常规育种及优选法、或通过生物技术及基因工程法、或通过所述方法的结合而获得的植物，包括转基因植物，也包括可受或不受植物种苗权保护的植物栽培种。植物部位的含义应理解为植物所有的地上和地下部位以及植物器官，例如芽、叶、花及根，可提及的实例有叶、针叶、茎、干、花、子实体、果实和种子，以及根、块茎及根茎。植物部位还包括采收物和无性及有性繁殖物，例如幼苗、块茎、根茎、插条 (cutting) 及种子。

如上面所提及，可依据本发明处理所有植物及其部位。在一个优选实施方案中，处理野生植物种和植物栽培种，或由常规生物育种法—例如杂交或原生质体融合—获得的植物种和植物栽培种，以及所述植物种和植物栽培种的部位。在另一优选实施方案中，处理由基因工程、如果合适还可与常规方法相结合而获得的转基因植物及植物栽培种（遗传修饰的生物 (Genetically Modified Organism)）及它们的部位。术语“部位”或“植物的部位”或“植物部位”解释如上。

特别优选依据本发明处理各自可商购获得的或已被使用的植物栽培种的植株。植物栽培种的含义应理解为由常规育种、诱变或重组 DNA 技术获得的具有新特性（“特征”）的植物。它们可以是栽培种、变种 (variety)、生物型 (biotype) 或基因型。

依据植物种或植物栽培种、其种植地点和生长条件（土壤、气候、

生长期、营养),本发明的处理也可产生超加和性(superadditive) (“协同”)效应。由此可获得超过实际预期的效果,例如,可降低本发明使用的物质和组合物的施用率和/或加宽其作用谱和/或提高其活性、改善植物生长、提高高温或低温耐受性、提高干旱或者水或土壤含盐量耐受性、提高开花品质、使采收更简易、加速成熟、提高采收产量、改善采收产品的质量和/或提高其营养价值、改善采收产品的贮存稳定性和/或其加工性能。

优选依据本发明处理的转基因植物或植物栽培种(即通过遗传工程而获得的品种)包括在基因修饰中接受了遗传物质的所有植物,所述遗传物质赋予了所述植物特别有利的有用特性(“特征”)。所述特性的实例有改善植物生长、提高高温或低温耐受性、提高干旱或者水或土壤含盐量耐受性、提高开花品质、使采收更简易、加速成熟、提高采收产量、改善采收产品的质量和/或提高其营养价值、改善采收产品的贮存稳定性和/或其加工性能。还需特别强调的所述特性的实例有改善植物对动物和微生物有害物的抵抗力,例如对昆虫、螨虫、植物致病真菌、细菌和/或病毒的抵抗力,以及提高植物对某些除草活性化合物的耐受性。可提及的转基因植物的实例为重要的作物植物,例如谷物(小麦、稻)、玉米、大豆、马铃薯、棉花、烟草、油菜和果实植物(苹果、梨、柑橘类水果以及葡萄),特别强调的为玉米、大豆、马铃薯、棉花、烟草和油菜。特别强调的特征为通过在植物体内形成的毒素,特别是由苏云金杆菌的遗传物质(例如基因Cry I A(a)、Cry I A(b)、Cry I A(c)、Cry II A、Cry III A、Cry III B2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb和Cry I F及其结合)在植物体内形成的毒素,来提高植物对昆虫、蛛形纲动物、线虫和蛞蝓以及蜗牛的抵抗力(以下简称为“Bt植物”)。还特别强调的特征为通过系统获得性抗性(SAR)、系统素、植物抗毒素、引发物(elicitor)和抗性基因以及相应的表达蛋白质和毒素来提高植物对真菌、细菌和病毒的抵抗力。此外特别强调的特性为提高植物对某些除草活性化合物的耐受性,例如对咪唑啉酮类、磺酰脲类、草甘磷(glyphosate)或草丁膦(phosphinotricin)的耐受性(例如“PAT”基因)。赋予所述所需特征的基因也可在转基因植物体内相互结合而存在。可提及的“Bt植物”的实例有市售的商标名称为YIELD GARD®(例如玉米、棉花、大豆)、

KnockOut[®] (例如玉米)、StarLink[®] (例如玉米)、Bollgard[®] (棉花)、Nucoton[®] (棉花)和NewLeaf[®] (马铃薯)的玉米品种、棉花品种、大豆品种和马铃薯品种。可提及的除草剂耐受性植物的实例有市售的商标名称为Roundup Ready[®] (具有草甘磷耐受性,例如玉米、棉花、大豆)、Liberty Link[®] (具有草丁膦耐受性,例如油菜)、IMI[®] (具有咪唑啉酮耐受性)和STS[®] (具有磺酰脲耐受性,例如玉米)的玉米品种、棉花品种和大豆品种。可提及的具有除草剂抗性的植物(以常规的除草剂耐受性方式育种的植物)还包括名称为Clearfield[®] (例如玉米)的市售品种。当然,以上叙述也适用于具有所述基因特征的或基因特征待开发的植物栽培种,所述植物栽培种将在未来进行开发和/或上市。

所列植物可用本发明活性化合物混合物以特别有利的方式依据本发明进行处理。上述活性化合物或混合物的优选范围也适用于所述植物的处理。特别强调用本发明中具体提及的混合物处理植物。

用活性化合物依据本发明对植物及植物部位的处理依据常规处理方法直接地或通过作用于其环境、生境或贮存区域来进行,所述常规处理方法例如浸泡、喷雾、蒸发、弥雾(atomizing)、撒播、涂抹(brushing-on),在繁殖物、特别是种子的情况下,也可涂布一层或多层。

可将本发明活性化合物结合物转化成常规制剂,例如溶液、乳剂、悬浮剂、粉剂、泡沫、膏剂、颗粒剂、气雾剂、位于聚合物与种子包衣组合物中的微胶囊剂,以及ULV制剂。

所述制剂以已知方式制备,例如将活性化合物或活性化合物结合物与填充剂混合,即与液体溶剂、加压液化气和/或固体载体混合,任选使用表面活性剂,即乳化剂和/或分散剂和/或发泡剂。如果所用填充剂为水,还可使用例如有机溶剂作为辅助溶剂。适合的液体溶剂主要有:芳香族化合物,例如二甲苯、甲苯或烷基苯;氯化芳香族化合物或氯化脂肪烃,例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂肪烃,例如环己烷或石蜡,如石油馏分;醇,例如丁醇或乙二醇及它们的醚及酯;酮,例如丙酮、甲乙酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂,例如二甲基甲酰胺或二甲基亚砷;或水。液化气填充剂或载体的含义应理解为在标准温度及大气压下为气态的液体,例如气溶胶喷雾剂,如卤代烃,

或丁烷、丙烷、氮气及二氧化碳。适合的固体载体有：例如粉碎的天然矿物，例如高岭土、粘土、滑石粉、白垩、石英、凹凸棒石、蒙脱石或硅藻土；以及粉碎的合成矿物，例如细分散二氧化硅、氧化铝及硅酸盐。适用于颗粒剂的固体载体有：例如粉碎并分级的天然岩石，如方解石、浮石、大理石、海泡石及白云石；或合成的无机及有机粉颗粒，以及有机物颗粒，例如锯木屑、椰壳、玉米穗轴及烟草茎。适合的乳化剂和/或发泡剂有：例如非离子及阴离子乳化剂，例如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐，或蛋白质水解产物。适合的分散剂有：例如木素亚硫酸盐废液及甲基纤维素。

制剂中可使用增粘剂，例如羧甲基纤维素，粉末、颗粒或胶乳形式的天然及合成聚合物，例如阿拉伯树胶、聚乙烯醇及聚乙酸乙烯酯，或天然磷脂，例如脑磷脂和卵磷脂及合成磷脂。其它添加剂可为矿物油和植物油。

可使用着色剂，例如无机颜料，如氧化铁、氧化钛及普鲁士蓝，以及有机染料，如茜素染料、偶氮染料及金属酞菁染料，以及微量营养物，如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐及锌盐。

制剂通常含有 0.1 至 95 重量百分比的活性化合物，优选 0.5 至 90%。

本发明的活性化合物也可以其本身或以其制剂形式与已知的杀真菌剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂或杀昆虫剂混合使用，以例如拓宽其作用谱或防止抗性的产生。

杀真菌剂：

1. 核酸合成抑制剂

苯霜灵 (benalaxyl)、精苯霜灵 (benalaxyl-M)、磺嘧菌灵 (bupirimate)、chiralaxyl、clozylacon、甲菌定 (dimethirimol)、乙菌定 (ethirimol)、呋氯丙灵 (furalaxyl)、土菌消 (hymexazole)、精甲霜灵 (metalaxyl-M)、甲呋酰胺 (ofurace)、噁霜灵 (oxadixyl)、喹菌酮 (oxolinic acid)

2. 有丝分裂和细胞分裂抑制剂

苯菌灵 (benomyl)、多菌灵 (carbendazim)、乙霉威 (diethofencarb)、麦穗宁 (fuberidazole)、戊菌隆 (pencycuron)、涕必灵 (thiabendazole)、甲基托布津 (thiophanate-methyl)、苯酰菌胺 (zoxamide)

3. 呼吸链抑制剂

3.1 复合物 I

氟嘧菌胺 (diflumetorim)

3.2 复合物 II

啉酰菌胺 (boscalid)、萎锈灵 (carboxin)、甲呋啉苯胺 (fenfuram)、氟酰胺 (flutolanil)、呋吡唑灵 (furametpyr)、丙氧灭锈胺 (mepronil)、氧化萎锈灵 (oxycarboxin)、吡噻菌胺 (penthioopyrad)、溴氟唑菌 (thi-fluzamide)

3.3 复合物 III

腈嘧菌酯 (azoxystrobin)、氰霜唑 (cyazofamid)、醚菌胺 (dimoxystrobin)、enestrobin、噁唑菌酮 (famoxadone)、咪唑菌酮 (fenamidone)、氟嘧菌酯 (fluoxastrobin)、亚胺菌 (kresoxim-methyl)、叉氨苯酰胺 (metominostrobin)、肟醚菌胺 (orysastrobin)、吡唑醚菌酯 (pyraclostrobin)、啉氧菌酯 (picoxystrobin)

3.4 解偶剂

敌螨普 (dinocap)、氟啉胺 (fluazinam)

3.5 ATP 产生抑制剂

薯瘟锡 (fentin acetate)、三苯锡氯 (fentin chloride)、毒菌锡 (fentin hydroxide)、硅噻菌胺 (silthiofam)

4. 氨基酸和蛋白质生物合成抑制剂

胺扑灭 (andoprim)、灭瘟素 (blasticidin-S)、嘧菌环胺 (cyprodinil)、春雷霉素 (kasugamycin)、春雷霉素一水合盐酸盐 (kasugamycin hydrochloride hydrate)、嘧菌胺 (mepanipyrim)、二甲嘧菌胺 (pyrimethanil)

5. 信号转导抑制剂

拌种咯 (fenpiclonil)、氟噁菌 (fludioxonil)、喹氧灵

(quinoxifen)

6. 脂类和膜合成抑制剂

乙菌利 (chlozolinate)、异丙定 (iprodone)、杀菌利 (procymidone)、烯菌酮 (vinclozolin)

定菌磷 (pyrazophos)、克瘟散 (edifenphos)、异稻瘟净 (iprobenfos) (IBP)、稻瘟灵 (isoprothiolane)

甲基立枯磷 (tolclofos-methyl)、联苯 iodocarb、百维灵 (propamocarb)、百维灵单盐酸盐 (propamocarb hydrochloride)

7. 麦角固醇生物合成抑制剂

环酰菌胺 (fenhexamid)

戊环唑 (azaconazole)、双苯三唑醇 (bitertanol)、糠菌唑 (bromuconazole)、环唑醇 (cyproconazole)、苜氯三唑醇 (diclobutrazole)、噁醚唑 (difenoconazole)、烯唑醇 (diniconazole)、烯唑醇-M (diniconazole-M)、氧唑菌 (epoxiconazole)、乙环唑 (etaconazole)、腈苯唑 (fenbuconazole)、喹唑菌酮 (fluquinconazole)、氟硅唑 (flusilazole)、粉唑醇 (flutriafol)、呋菌唑 (furconazole)、呋醚唑 (furconazole-cis)、己唑醇 (hexaconazole)、酰胺唑 (imibenconazole)、环戊唑醇 (ipconazole)、环戊唑菌 (metconazole)、腈菌唑 (myclobutanil)、多效唑 (paclobutrazol)、戊菌唑 (penconazole)、丙环唑 (propiconazole)、丙硫菌唑 (prothioconazole)、硅氟唑 (simeconazole)、戊唑醇 (tebuconazole)、氟醚唑 (tetraconazole)、三唑酮 (triadimefon)、唑菌醇 (triadimenol)、戊叉唑菌 (triticonazole)、烯效唑 (uniconazole)、伏立康唑 (voriconazole)、抑霉唑 (imazalil)、烯菌灵 (imazalil sulphate)、恶咪唑 (oxpoconazole)、异噁菌醇 (fenarimol)、呋啉醇 (flurprimidol)、氟苯嘧啶醇 (nuarimol)、啉斑肟 (pyrifenox)、噻氟灵 (triforine)、稻瘟酯 (pefurazoate)、丙氯灵 (prochloraz)、氟菌唑 (triflumizole)、烯霜苯唑 (viniconazole)、

aldimorph、十二环吗啉 (dodemorph)、十二环吗啉乙酸盐

(dodemorph acetate)、丁苯吗啉(fenpropimorph)、克啉菌(tridemorph)、苯锈啉(fenpropidin)、螺噁茂胺(spiroxamine)、萘替芬(naftifine)、稗草畏(pyributicarb)、特比萘芬(terbinafine)

8. 细胞壁合成抑制剂

苯噻菌胺(benthiavalicarb)、双丙氨膦(bialaphos)、烯酰吗啉(dimethomorph)、氟吗啉(flumorph)、缬霉威(iprovalicarb)、多抗霉素(polyoxins)、多氧霉素(polyoxorim)、有效霉素 A(validamycin A)

9. 黑色素生物合成抑制剂

环丙酰菌胺(capropamid)、双氯氰菌胺(diclocymet)、稻瘟酰胺(fenoxanil)、四氯苯酞(phthalide)、咯嗪酮(pyroquilon)、三环唑(tricyclazole)

10. 抗性诱导剂

苯并噻二唑(acibenzolar-S-methyl)、噻菌灵(probenazole)、噻酰菌胺(tiadinil)

11. 具有多位点活性的化合物

敌菌丹(captafol)、克菌丹、百菌清(chlorothalonil)、铜盐例如: 氢氧化铜、环烷酸铜、氯化铜(copper oxychloride)、硫酸铜、一氧化铜、喹啉铜(oxine copper)和波尔多液, 抑菌灵(dichlofluanid)、二氰蒞醌(dithianon)、多果定(dodine)、多果定游离碱(dodine free base)、福美铁(ferbam)、氟灭菌丹(fluorofolpet)、灭菌丹(folpet)、藻菌磷(fosetyl-Al)、双胍辛盐(guazatine)、双胍辛乙酸盐(guazatine acetate)、双胍辛胺(iminoctadine)、双八胍盐(iminoctadine albesilate)、双胍辛胺乙酸盐(iminoctadine triacetate)、代森锰铜(mancopper)、代森锰锌(mancozeb)、代森锰(manzeb)、代森联(metiram)、代森联锌(metiram-zinc)、丙森锌(propineb)、硫和硫制剂包括多硫化钙、福美双(thiram)、对甲抑菌灵(tolyfluanid)、代森锌(zineb)、福美锌(ziram)

12. 未知机制化合物

amibromdol、苯噻硫氰(benthiazole)、bethoxazin、卡巴西霉

素 (capsimycin)、香芹酮 (carvone)、灭螨猛 (chinomethionat)、氯化苦 (chloropicrin)、硫杂灵 (cufraneb)、环氟菌胺 (cyflufenamid)、清菌脲 (cymoxanil)、棉隆 (dazomet)、咪菌威 (debacarb)、哒菌酮 (diclomezine)、双氯酚 (dichlorophen)、氯硝胺 (dicloran)、野燕枯 (difenzoquat)、野燕枯甲基硫酸酯 (difenzoquat methyl sulphate)、二苯胺 (diphenylamine)、韩乐宁 (ethaboxam)、噻菌脞 (ferimzone)、氟酰菌胺 (flumetover)、磺菌胺 (flusulfamide)、氟啶酰菌胺 (fluopicolide)、氟氯菌核利 (fluoroimide)、六氯苯 (hexachlorobenzene)、8-羟基喹啉、人间霉素 (irumamycin)、磺菌威 (methasulfocarb)、苯菌酮 (metrafenone)、异硫氰酸甲酯 (methyl isothiocyanate)、米多霉素 (mildiomyacin)、多马霉素 (natamycin)、福美镍 (nickel dimethyldithiocarbamate)、酞菌酯 (nitrothal-isopropyl)、异噻菌酮 (octhilinone)、oxamocarb、oxyfenthiin、五氯苯酚 (pentachlorophenol) 及其盐、2-苯基苯酚及其盐、粉病灵 (piperalin)、propanosine-sodium、丙氧喹啉 (proquinazid)、吡咯菌素 (pyrrolnitrin)、五氯硝基苯 (quintozene)、叶枯酞 (tecloftalam)、四氯硝基苯 (tecnazene)、唑菌嗪 (triazoxide)、水杨菌胺 (trichlamide)、氟菌胺 (zarilamid) 以及 2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺酰基)吡啶、N-(4-氯-2-硝基苯基)-N-乙基-4-甲基苯磺酰胺、2-氨基-4-甲基-N-苯基-5-噻唑甲酰胺、2-氯-N-(2,3-二氢-1,1,3-三甲基-1H-茛-4-基)-3-吡啶甲酰胺、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基异噻唑烷-3-基]吡啶、顺-1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)环庚醇、2,4-二氢-5-甲氧基-2-甲基-4-[[[[1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]氨基]氧基]甲基]苯基]-3H-1,2,3-三唑-3-酮 (185336-79-2)、1-(2,3-二氢-2,2-二甲基-1H-茛-1-基)-1H-咪唑-5-羧酸甲酯、3,4,5-三氯-2,6-吡啶二腈、2-[[[环丙基-[(4-甲氧基苯基)亚氨基]甲基]硫基]甲基]- α -(甲氧基亚甲基)苄基乙酸甲酯、4-氯- α -丙炔氧基-N-[2-[3-甲氧基-4-(2-丙炔氧基)苯基]乙基]苯乙酰胺、(2S)-N-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔基]氧]-3-甲氧基苯基]乙基]-3-甲基-2-[(甲基磺酰基)氨基]丁酰胺、5-氯-7-(4-甲基哌啶-1-

基)-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶、5-氯-6-(2,4,6-三氟苯基)-N-[(1R)-1,2,2-三甲基丙基][1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-7-胺、5-氯-N-[(1R)-1,2-二甲基丙基]-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-7-胺、N-[1-(5-溴-3-氯代吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯烟酰胺、N-(5-溴-3-氯代吡啶-2-基)甲基-2,4-二氯烟酰胺、2-丁氧基-6-碘-3-丙基苯并吡喃-4-酮、N-[(Z)-[(环丙基甲氧基)亚氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基]-2-苯乙酰胺、N-(3-乙基-3,5,5-三甲基环己基)-3-甲酰基氨基-2-羟基苯甲酰胺、2-[[[[[1-[3-(1-氟-2-苯基乙基)氧基]苯基]亚乙基]氨基]氧基]甲基]- α -(甲氧基亚氨基)-N-甲基- α E-苯乙酰胺、N-{2-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]乙基}-2-(三氟甲基)苯甲酰胺、N-(3',4'-二氯-5-氟联苯基-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、N-(6-甲氧基-3-吡啶基)环丙烷甲酰胺、1-[(4-甲氧基苯氧基)甲基]-2,2-二甲基丙基-1H-咪唑-1-羧酸、0-[1-[(4-甲氧基苯氧基)甲基]-2,2-二甲基丙基]-1H-咪唑-1-硫代羧酸、2-(2-{[6-(3-氯-2-甲基苯氧基)-5-氟嘧啶-4-基]氧基}苯基)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺

杀细菌剂:

溴硝丙二醇 (bronopol)、双氯酚、三氯甲基吡啶 (nitrapyrin)、福镁镍 (nickel dimethyldithiocarbamate)、春雷霉素、异噻菌酮 (octhilinone)、羧酸呋喃 (furancarboxylic acid)、土霉素 (oxytetracyclin)、噻菌灵、链霉素 (streptomycin)、叶枯酞、硫酸铜和其它铜制剂。

杀昆虫剂/杀螨剂/杀线虫剂:

1. 乙酰胆碱酯酶 (AChE) 抑制剂

1.1 氨基甲酸酯类 (例如, 棉铃威 (alanycarb)、涕灭威 (aldicarb)、砒灭威 (aldoxycarb)、除害威 (allyxycarb)、灭害威 (aminocarb)、甲基吡恶磷 (azamethiphos)、噁虫威 (bendiocarb)、丙硫克百威 (benfuracarb)、必克虱 (bufencarb)、畜虫威 (butacarb)、丁叉威 (butocarboxim)、氧丁叉威 (butoxycarboxim)、西维因

甲胺磷 (methamidophos)、杀扑磷 (methidathion)、速灭磷 (mevinphos)、久效磷 (monocrotophos)、二溴磷 (naled)、氧化乐果 (omethoate)、砒吸磷 (oxydemeton-methyl)、甲基对硫磷 (parathion methyl)、对硫磷 (parathion-ethyl)、稻丰散 (phenthoate)、三九一一 (phorate)、伏杀磷 (phosalone)、亚胺硫磷 (phosmet)、磷胺 (phosphamidon)、乙丙磷威 (phosphocarb)、腈肟磷 (phoxim)、虫螨磷 (pirimiphos methyl)、乙基虫螨磷 (pirimiphos ethyl)、丙溴磷 (profenofos)、丙虫磷 (propaphos)、烯虫磷 (propetamphos)、丙硫磷 (prothiofos)、发果 (prothoate)、吡唑硫磷 (pyraclofos)、打杀磷 (pyridaphenthion)、pyridathion、喹噁磷 (quinalphos)、硫线磷 (sebufos)、硫特普 (sulfotep)、乙丙硫磷 (sulprofos)、噁丙磷 (tebupirimphos)、双硫磷 (temephos)、特丁磷 (terbufos)、杀虫畏 (tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷 (thiometon)、三唑磷 (triazophos)、敌百虫 (trichlorfon)、蚜灭多 (vamidothion)

2. 钠通道调节剂/电位门控 (voltage-gated) 钠通道阻断剂

2.1 拟除虫菊酯类 (例如, 氟酯菊酯 (acrinathrin)、丙烯除虫菊 (d-顺-反, d-反) (allethrin (d-cis-trans, d-trans))、 β -氟氰菊酯 (beta-cyfluthrin)、氟氰菊酯 (bifenthrin)、反丙烯除虫菊 (bioallethrin)、反丙烯除虫菊-S-环戊基-异构体、bioethanomethrin、生物氟菊酯 (biopermethrin)、右旋反灭虫菊酯 (bioresmethrin)、chlovaporthrin、顺-氟氰菊酯、顺-灭虫菊 (cis-resmethrin)、顺-氟菊酯 (cis-permethrin)、功夫菊酯 (clopythrin)、乙氟菊酯 (cycloprothrin)、氟氰菊酯 (cyfluthrin)、氟氰菊酯 (cyhalothrin)、氟氰菊酯 (α -、 β -、 θ -、 ζ -) (cypermethrin (alpha-, beta-, theta-, zeta-))、苯醚氟菊酯 (cyphenothrin)、DDT、溴氟菊酯 (deltamethrin)、烯炔菊酯 (1R-异构体) (empenthrin (1R-isomer))、高氟戊菊酯 (esfenvalerate)、醚菊酯 (etofenprox)、五氟苯菊酯 (fenfluthrin)、甲氟菊酯 (fenpropathrin)、吡氟菊酯 (fenpyrithrin)、灭杀菊酯 (fenvalerate)、溴氟菊酯 (flubrocycythrinate)、氟氰戊菊酯 (flucythrinate)、氟丙苄醚 (flufenprox)、氟氰苯菊酯

(flumethrin)、氟胺氰菊酯 (fluvalinate)、fubfenprox、 γ -氯氟氰菊酯 (gamma-cyhalothrin)、炔咪菊酯 (imiprothrin)、噻唛菊酯 (kadethrin)、 λ -氯氟氰菊酯 (lambda-cyhalothrin)、甲氧苄氟菊酯 (metofluthrin)、氯菊酯 (顺-、反-)、苯醚菊酯 (1R-反式异构体) (phenothrin (1R-trans isomer))、炔酮菊酯 (prallethrin)、丙氟菊酯 (profluthrin)、protrifenbute、反灭虫菊 (pyresmethrin)、灭虫菊、RU-15525、灭虫硅醚 (silaflluofen)、氟胺氰菊酯 (tau-fluvalinate)、七氟菊酯 (tefluthrin)、环戊烯丙菊酯 (terallethrin)、胺菊酯 (1R-异构体) (tetramethrin (1R-isomer))、四溴菊酯 (tralomethrin)、四氟菊酯 (transfluthrin)、ZXI 8901、除虫菊素 (pyrethrins) (除虫菊 (pyrethrum))

2.2 噁二嗪类 (oxadiazines) (例如噁二唑虫 (indoxacarb))

3. 乙酰胆碱受体激动剂/拮抗剂

3.1 氯烟碱基类 (chloronicotinyls) / 新烟碱类 (neonicotinoids) (例如, 吡虫清 (acetamiprid)、噻虫胺 (clothianidin)、呋虫胺 (dinotefuran)、吡虫啉 (imidacloprid)、硝胺烯啶 (nitenpyram)、硝虫噻嗪 (nithiazine)、噻虫啉 (thiacloprid)、噻虫嗪 (thiamethoxam))

3.2 烟碱 (nicotine)、杀虫磺 (bensultap)、巴丹 (cartap)

4. 乙酰胆碱受体调节剂

4.1 spinosyn 类 (例如艾克敌 105 (spinosad))

5. GABA 门控氯通道拮抗剂

5.1 环戊二烯有机氯类 (例如, 毒杀芬 (camphechlor)、氯丹 (chlordan)、硫丹 (endosulfan)、林丹 (gamma-HCH)、HCH、七氯 (heptachlor)、林丹 (lindane)、甲氧滴滴涕 (methoxychlor))

5.2 fiprole 类 (例如, 乙酞虫睛 (acetoprole)、乙虫清 (ethiprole)、锐劲特 (fipronil)、氟吡唑虫 (vaniliprole))

6. 氯通道激活剂类

6.1 Mectin 类 (例如, 阿维菌素 (abamectin, avermectin)、埃玛菌素 (emamectin)、埃玛菌素苯甲酸盐 (emamectin-benzoate)、伊维菌素 (ivermectin)、弥拜菌素 (milbemectin)、米尔倍霉素

(milbemycin))

7. 保幼激素模拟物 (mimetic) 类

(例如, 噁茂醚 (diofenolan)、保幼醚 (epofenonane)、双氧威 (fenoxycarb)、蒙五—二 (hydroprene)、蒙七—七 (kinoprene)、蒙五—五 (methoprene)、蚊蝇醚 (pyriproxifen)、烯虫硫酯 (triprene))

8. 蜕皮激素激动剂/干扰剂类

8.1 二酰基胍类 (例如, 环虫酰胍 (chromafenozide)、特丁苯酰胍 (halofenozide)、甲氧苯酰胍 (methoxyfenozide)、双苯酰胍 (tebufenozide))

9. 几丁质生物合成抑制剂

9.1 苯甲酰脲类 (例如, 双三氟虫脲 (bistrifluron)、定虫隆 (chlorfluazuron)、氟脲杀 (diflubenzuron)、氟啶蝉脲 (fluazuron)、氟螨脲 (flucycloxuron)、氟虫脲 (flufenoxuron)、氟铃脲 (hexaflumuron)、氟丙氧脲 (lufenuron)、双苯氟脲 (novaluron)、多氟脲 (noviflumuron)、氟幼脲 (penfluron)、伏虫磷 (teflubenzuron)、杀虫隆 (triflumuron))

9.2 噻嗪酮 (buprofezin)

9.3 灭蝇胺 (cyromazine)

10. 氧化磷酸化抑制剂类, ATP 干扰剂类

10.1 杀螨硫隆 (diafenthiuron)

10.2 有机锡类 (例如唑环锡 (azocyclotin)、三环锡 (cyhexatin)、杀螨锡 (fenbutatin-oxide))

11. 通过间断 H-质子梯度而起作用的氧化磷酸化去偶剂类

11.1 吡咯类 (例如氟唑虫清 (chlorfenapyr))

11.2 二硝基酚类 (例如乐杀螨 (binapacryl)、敌螨通 (dinobuton)、敌螨普 (dinocap)、DNOC)

12. 位点-I 电子转移抑制剂类

12.1 METI 类 (例如喹螨醚 (fenazaquin)、唑螨酯 (fenpyroximate)、噻胺苯醚 (pyrimidifen)、哒螨酮 (pyridaben)、吡螨胺 (tebufenpyrad)、唑虫酰胺 (tolfenpyrad))

12.2 灭蚁腴 (hydramethylnone)

12.3 开乐散 (dicofol)

13. 位点-II 电子转移抑制剂类

13.1 鱼藤酮 (rotenone)

14. 位点-III 电子转移抑制剂类

14.1 灭螨醌 (acequinocyl)、嘧螨酯 (fluacrypyrim)

15. 昆虫肠道膜微生物干扰剂类

苏云金杆菌 (*Bacillus thuringiensis*) 菌株

16. 脂肪合成抑制剂类

16.1 特窗酸类 (例如, 螺螨酯 (spirodiclofen)、螺甲螨酯 (spiromesifen))

16.2 特特拉姆酸类 (tetramic acids) (例如, 3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1-氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙基碳酸酯 (又称: 碳酸 3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1-氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙基酯, CAS 注册号: 382608-10-8) 以及碳酸顺-3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1-氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙基酯 (CAS 注册号: 203313-25-1))

17. 甲酰胺类

(例如 氟啶虫酰胺 (flonicamid))

18. 章鱼胺能激动剂类

(例如 虫螨脒 (amitraz))

19. 镁刺激的 ATP 酶抑制剂类

(例如 克螨特 (propargite))

20. 邻苯二酰胺类

(例如 N^2 -[1,1-二甲基-2-(甲基磺酰基)乙基]-3-碘- N^1 -[2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基]-1,2-苯二甲酰胺 (CAS 注册号: 272451-65-7)、氟虫酰胺 (flubendiamide))

21. 沙蚕毒素类似物

(例如 硫赐安 (thiocyclam hydrogen oxalate)、杀虫双 (thiosultap-sodium))

22. 生物制剂类、激素类或信息素类

(例如, 艾扎丁 (azadirachtin)、杆菌属种 (Bacillus spec.)、僵菌属种 (Beauveria spec.)、十二碳二烯醇 (Codlemone)、绿僵菌属种 (Metarrhizium spec.)、拟青霉属种 (Paecilomyces spec.)、敌贝特 (Thuringiensin)、轮枝菌属种 (Verticillium spec.))

23. 具有未知或未确定作用机理的活性化合物类

23.1 熏蒸剂类 (例如, 磷化铝、一溴甲烷、硫酰氟)

23.2 选择性拒食剂类 (例如, 冰晶石、氟啶虫酰胺 (flonicamid)、拒嗪酮 (pymetrozine))

23.3 螨生长抑制剂类 (例如, 四螨嗪 (clofentezine)、特苯噁唑 (etoxazole)、噻螨酮 (hexythiazox))

23.4 amidoflumet、benclothiaz、苯螨特 (benzoximate)、联苯肼酯 (bifenazate)、溴螨酯 (bromopropylate)、噻嗪酮 (buprofezin)、灭螨锰 (chinomethionat)、杀虫脒 (chlordimeform)、乙酯杀螨醇 (chlorobenzilate)、氯化苦 (chloropicrin)、clothiazoben、cycloprene、cyflumetofen、地昔尼尔 (dicyclanil)、fenoxacrim、氟硝二苯胺 (fentrifanil)、噻唑螨 (flubenzimine)、flufenerim、氟替阿嗪 (flutenzin)、诱虫十六酯 (gossyplure)、灭蚁脘 (hydramethylnone)、japonilure、恶虫酮 (metoxadiazone)、石油、胡椒基丁醚 (piperonyl butoxide)、油酸钾、pyrafluprole、啉虫丙醚 (pyridalyl)、pyriprole、氟虫胺 (sulfluramid)、三氯杀螨砜 (tetradifon)、杀螨好 (tetrasul)、苯赛螨 (triarathene)、增效炔醚 (verbutin),

以及化合物丙基氨基甲酸 3-甲基苯基酯 (Tsumacide Z)、化合物 3-(5-氯-3-吡啶基)-8-(2,2,2-三氟乙基)-8-氮杂二环[3.2.1]辛-3-腈 (CAS 注册号 185982-80-3) 以及相应的 3-内异构体 (CAS 注册号 185984-60-5) (参见 WO 96/37494、WO 98/25923), 以及含有杀昆虫的活性植物提取物、线虫、真菌或病毒的制剂。

与其它已知活性化合物例如除草剂的混合物, 或与肥料以及生长调节剂、安全剂和/或化学信息素的混合物也是可以的。

化合物 (I) 和 (II) 可同时施用或相继地施用, 并且如果同时施用

的话，可一起或分别地施用；在分别施用的情况下，其顺序通常对防治结果无影响。

活性化合物结合物可以其本身、其制剂形式或由其制备的使用形式使用，例如即用型溶液剂、乳油、乳剂、悬浮剂、可湿性粉剂、可溶性粉剂及颗粒剂。施用以常规方式进行，例如浇灌、喷雾、雾化、撒播、撒粉、干敷、湿敷 (moistened dressing, wet dressing)、浆敷 (slurry dressing) 或皮壳包覆 (encrusting) 等。

当使用本发明活性化合物结合物时，施用率依据施用类型可在相对宽的范围内变化。对于植物部位的处理，活性化合物结合物的施用率通常为 0.1 至 10000 g/ha，优选 10 至 1000 g/ha。对于拌种，活性化合物结合物的施用率通常为每公斤种子 0.001 至 50 g，优选每公斤种子 0.01 至 10 g。对于土壤的处理，活性化合物结合物的施用率通常为 0.1 至 10000 g/ha，优选 1 至 5000 g/ha。

本发明活性化合物结合物的良好杀菌活性可通过下面的实施例来证实。尽管单个活性化合物显示出弱的杀菌活性，但结合物显示出的活性超过各活性的简单加和。

当活性化合物结合物的杀菌活性大于各活性化合物单独施用的活性总和时，杀菌剂中必然存在协同效应。

对于一种给定的两种活性化合物的结合物，其预期活性可根据 S. R. Colby 的公式如下计算 ("Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations", Weeds 15 (1967), 20-22):

如果

X 表示以施用率 \underline{m} g/ha 使用活性化合物 A 时的药效，

Y 表示以施用率 \underline{n} g/ha 使用活性化合物 B 时的药效，

E 表示以施用率 \underline{m} 和 \underline{n} g/ha 使用活性化合物 A 和 B 时的药效，
则

$$E = X + Y - \frac{X \cdot Y}{100}$$

此处药效按%进行确定。0%表示相当于对照实验的药效，而 100% 药效表示未观察到侵染。

如果实际杀菌活性大于计算的活性，则结合物的活性具有超加和性：换言之，获得协同效应。在此情况下，实际观察到的药效一定大

于用上述式计算所得的预期药效的数值 (E)。

确定协同效应的另一种方法由 Tammes 模型提供 (Neth. J. Plant Path. 70 (1964) 73-80), 其中, 例如, 确定 90% 药效所需的理论剂量, 并将其同实际所需剂量进行比较。

通过以下实施例对本发明进行说明。但是, 本发明不受限于所述实施例。

实施例

颖枯壳小球腔菌 (*Leptosphaeria nodorum*) 试验 (小麦) / 保护性

溶剂: 50 重量份的 N,N-二甲基乙酰胺

乳化剂: 1 重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

为制备合适的活性化合物制剂, 将 1 重量份的活性化合物或活性化合物结合物与所述量的溶剂和乳化剂混合, 并将该浓液用水稀释至所需浓度, 或者将活性化合物或活性化合物结合物的含水市售制剂用水稀释至所需浓度。

为测试保护活性, 用活性化合物制剂以所述施用率喷洒幼小植株。喷洒涂层干燥后, 用颖枯壳小球腔菌的孢子悬浮液喷洒植株。然后将植株置于约 20°C、相对大气湿度为 100% 的培养室中保持 48 小时。

将所述植株放入约 20°C、相对大气湿度为 80% 的温室中。

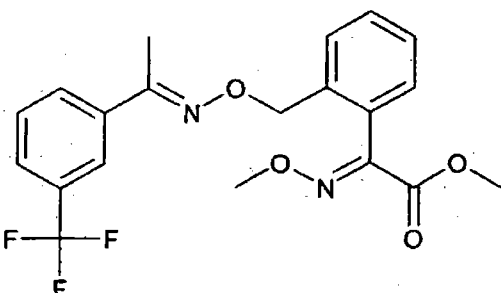
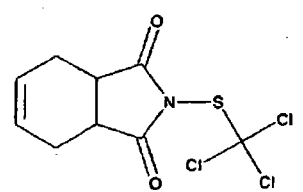
接种 10 天后进行评定。此处, 0% 表示相当于对照实验的药效, 而 100% 药效表示未观察到侵染。

从以下示例可明显看出, 优选的活性化合物结合物具有良好的杀菌活性, 而其它活性化合物结合物在其杀菌活性方面较弱。优选的活性化合物结合物的活性超过各活性的简单加和。

下表清楚地表明, 本发明活性化合物结合物的实测活性大于计算得到的活性, 即存在协同效应。对于本发明的混合比, 存在出人意料地显著的协同作用, 本发明混合比为 1:15 时具有最显著的协同效应。

表

颖枯壳小球腔菌试验(小麦)/保护性

已知的活性化合物:	以 ppm 计的活性化合物施用率	%药效
肟菌酯 	25	50
克菌丹 	500 375 82.5	25 25 50

本发明混合物:

	混合比	以 ppm 计的活性化合物施用率	实际药效	用 Colby 公式计算的预期值
肟菌酯 } + 克菌丹	1:20	25 + 500	} 75	63
肟菌酯 } + 克菌丹	1:15*	25 + 375	} 88	63
肟菌酯 } + 克菌丹	1:3.3	25 + 82.5	} 50	75

* 本发明的一个混合比