



## (12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 101410019 B

(45) 授权公告日 2012. 05. 02

(21) 申请号 200780011474. 4

(22) 申请日 2007. 03. 28

(30) 优先权数据

102006014487. 2 2006. 03. 29 DE

(85) PCT申请进入国家阶段日

2008. 09. 27

(86) PCT申请的申请数据

PCT/EP2007/002724 2007. 03. 28

(87) PCT申请的公布数据

W02007/112894 DE 2007. 10. 11

(73) 专利权人 拜尔农作物科学股份公司

地址 德国蒙海姆

(72) 发明人 H·亨格伯格 P·耶施克

R·维尔坦 T·申克 W·安德施

W·蒂勒特

(74) 专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司

公司 11285

代理人 钟守期 唐铁军

(51) Int. Cl.

A01N 51/00 (2006. 01)

A01N 43/40 (2006. 01)

A01P 7/04 (2006. 01)

A01P 7/02 (2006. 01)

(56) 对比文件

CN 1045261 A, 1990. 09. 12, 全文.

EP 0539588 A1, 1993. 05. 05, 全文.

CN 1646017 A, 2005. 07. 27, 全文.

US 2003134857 A1, 2003. 07. 17, 全文.

审查员 张春艳

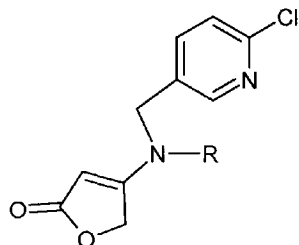
权利要求书 1 页 说明书 17 页

(54) 发明名称

具有杀虫特性的活性化合物结合物

(57) 摘要

本发明涉及新的活性化合物结合物, 包括至少一种已知的式 (I) 化合物以及另一种已知的选自新烟碱类的活性化合物, 其中

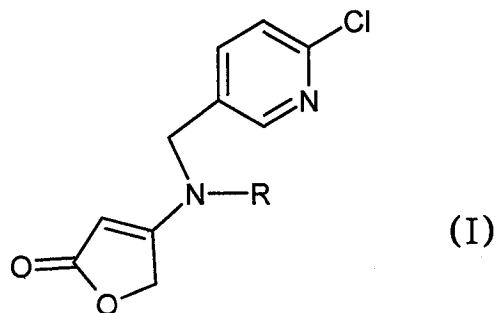


R 如说明书定义。

(I)

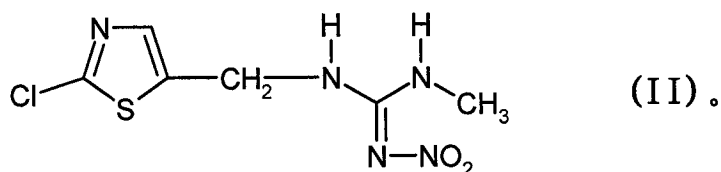
该结合物非常适合用于防治动物有害物, 例如昆虫。

1. 活性化合物结合物,包括至少一种式(I)化合物和式(II)的噻虫胺,其中式(I)化合物和式(II)的噻虫胺的混合比基于重量计为 625 : 1 至 1 : 625,



其中

R 代表甲基或环丙基,



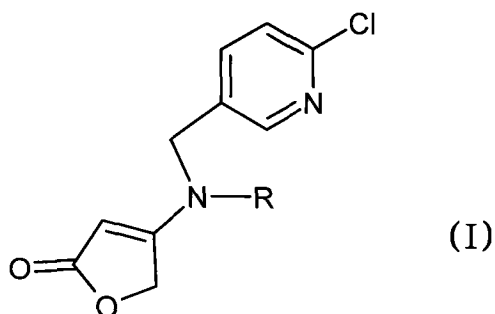
2. 如权利要求 1 中定义的活性化合物结合物用于防治动物有害物的用途。
3. 防治动物有害物的方法,其特征在于使如权利要求 1 定义的活性化合物结合物作用于动物有害物和 / 或其生境和 / 或种子上。
4. 权利要求 3 的方法,其特征在于使式 I 的活性化合物与噻虫胺同时作用于种子上。
5. 权利要求 3 的方法,其特征在于使式 I 的活性化合物与噻虫胺在不同时间作用于种子上。
6. 制备杀昆虫和杀螨虫的组合物的方法,其特征在于将如权利要求 1 定义的活性化合物结合物与填充剂和 / 或表面活性剂混合。
7. 权利要求 1 的活性化合物结合物用于处理种子的用途。
8. 权利要求 1 的活性化合物结合物用于处理转基因植物的用途。
9. 权利要求 1 的活性化合物结合物用于处理转基因植物种子的用途。

## 具有杀虫特性的活性化合物结合物

[0001] 本发明涉及新的活性化合物结合物 (combination), 该活性化合物结合物首先包括至少一种已知的式 (I) 化合物, 其次还包括一种属于新烟碱类的活性化合物, 该结合物非常适合用于防治动物有害物 (animal pest), 例如昆虫。

[0002] 已知式 (I) 化合物具有杀虫活性 (参见 EP-A0539588),

[0003]

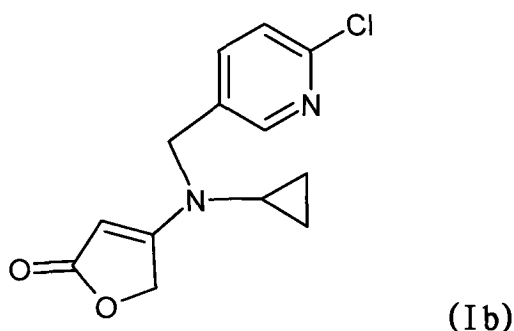
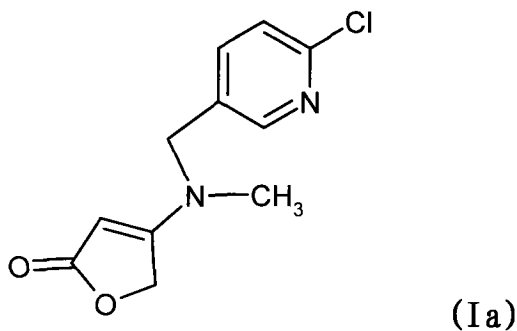


[0004] 其中

[0005] R 代表甲基或环丙基。

[0006] 具体而言, 可提及化合物 (Ia) 和 (Ib)。

[0007]

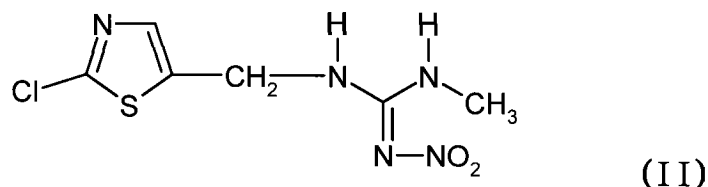


[0008] 这些化合物的活性良好, 但是在一些情况下还是不能令人满意。

[0009] 此外, 已知新烟碱类化合物噻虫胺 (clothianidin) 具有杀虫活性。

[0010] 噻虫胺具有结构式 (II), 并且已知于 EPA20376279。

[0011]



[0012] 令人惊奇的是,本发明活性化合物结合物的杀虫活性显著地高于单独活性化合物的活性总和。存在一种无法预见却真实存在的协同效应,并且不仅仅是活性的加和。

[0013] 除了至少一种式(I)活性化合物之外,本发明的活性化合物结合物还包括式(II)的噻虫胺。

[0014] 本发明优选式(Ia)化合物与式(II)化合物的结合物。

[0015] 本发明还优选式(Ib)化合物与式(II)化合物的结合物。

[0016] 当本发明的活性化合物结合物中的活性化合物以一定的重量比存在时,协同效应尤为显著。但是,活性化合物结合物中活性化合物的重量比可以在较宽的范围内变化。一般说来,本发明的结合物包括具有下述优选的和特别优选的混合比的式(I)活性化合物和噻虫胺:

[0017] 优选的混合比:625:1至1:625

[0018] 特别优选的混合比:25:1至1:25。

[0019] 该混合比基于重量比。该比例的含义应理解为式(I)的活性化合物:噻虫胺。

[0020] 本发明的活性化合物结合物由于兼具良好的植物耐受性和对温血动物有利的毒性以及良好的环境耐受性,因此适合用于保护植物和植物器官、提高收获产率、改善采收物的质量以及防治动物有害物,特别是农业、园艺、家畜饲养、森林、公园和休闲设施、贮存产品和材料保护以及卫生领域中遇到的昆虫、蛛形纲动物、蠕虫、线虫和软体动物。其可优选用作植物保护剂。它们对通常敏感和抗性物种以及全部或某些发育阶段具有活性。上述害虫包括:

[0021] 虱目(Anoplura)(Phthiraptera),例如,畜虱属(Damalinia spp.)、血虱属(Haematopinus spp.)、毛虱属(Linognathus spp.)、虱属(Pediculus spp.)、嚼虱属(Trichodectes spp.)。

[0022] 蛛形纲(Arachnida),例如,粗脚粉螨(Acarus siro)、柑橘瘤瘿螨(Aceria sheldoni)、刺皮瘿螨属(Aculops spp.)、针刺瘿螨属(Aculus spp.)、花蜱属(Amblyomma spp.)、锐缘蜱属(Argass spp.)、牛蜱属(Boophilus spp.)、短须螨属(Brevipalpus spp.)、苜蓿苔螨(Bryobia praetiosa)、皮螨属(Chorioptes spp.)、鸡皮刺螨(Dermanyssus gallinae)、始叶螨属(Eotetranychus spp.)、梨上瘿螨(Epitrimerus pyri)、真叶螨属(Eutetranychus spp.)、瘿螨属(Eriophyes spp.)、半跗线螨属(Hemitarsonemus spp.)、璃眼蜱属(Hyalomma spp.)、硬蜱属(Ixodes spp.)、黑寡妇蜘蛛(Latrodictus mactans)、Metatetranychus spp.、小爪螨属(Oligonychus spp.)、钝缘蜱属(Ornithodoros spp.)、全爪螨属(Panonychus spp.)、桔芸锈螨(Phyllocoptruta oleivora)、侧多食跗线螨(Polyphagotarsonemus latus)、痒螨属(Psoroptes spp.)、扇头蜱属(Rhipicephalus spp.)、根螨属(Rhizoglyphus spp.)、疥螨属(Sarcoptes spp.)、中东金蝎(Scorpio maurus)、Stenotarsonemus spp.、跗线螨属(Tarsonemus spp.)、叶螨属(Tetranychus spp.)、Vasates lycopersici。

[0023] 双壳软体动物 (Bivalva) 纲,例如,饰贝属种 (*Dreissena* spp.)。

[0024] 唇足目 (Chilopoda),例如,地蜈蚣属 (*Geophilus* spp.)、*Scutigera* spp.。

[0025] 鞘翅目 (Coleoptera),例如,菜豆象 (*Acanthoscelidesobtectus*)、喙丽金龟属 (*Adoretus* spp.)、杨树萤叶甲 (*Agelasticaalni*)、叩甲属 (*Agriotes* spp.)、马铃薯鳃角金龟 (*Amphimallon solstitialis*)、家具窃蠹 (*Anobium punctatum*)、星天牛属 (*Anoplophora* spp.)、花象属 (*Anthonomus* spp.)、圆皮蠹属 (*Anthrenus* spp.)、阿鳃金龟属 (*Apogonia* spp.)、*Atomaria* spp.、毛皮蠹属 (*Attagenus* spp.)、恶条豆象 (*Bruchidius obtectus*)、豆象属 (*Bruchus* spp.)、龟象属 (*Ceuthorhynchus* spp.)、*Cleonus mendicus*、宽胸叩头虫属 (*Conoderus* spp.)、根颈象属 (*Cosmopolites* spp.)、褐新西兰肋翅鳃角金龟 (*Costelytra zealandica*)、象虫属 (*Curculio* spp.)、杨干隐喙象 (*Cryptorhynchus lapathi*)、皮蠹属 (*Dermestes* spp.)、叶甲属 (*Diabrotica* spp.)、食植瓢虫属 (*Epilachna* spp.)、*Faustinus cubae*、裸蛛甲 (*Gibbium psylloides*)、黑异爪蔗金龟 (*Heteronychus arator*)、*Hylamorpha elegans*、北美家天牛 (*Hylotrupes bajulus*)、紫苜蓿叶象 (*Hypera postica*)、*Hypothenemus* spp.、甘蔗大褐齿爪鳃金龟 (*Lachnos ternacon sanguinea*)、马铃薯甲虫 (*Leptinotarsa decemlineata*)、稻根象 (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、筒喙象属 (*Lixus* spp.)、粉蠹属 (*Lyctus* spp.)、油菜花露尾甲 (*Meligethes aeneus*)、西方五月鳃角金龟 (*Melolontha melolontha*)、*Migdolus* spp.、墨天牛属 (*Monochamus* spp.)、*Naupactus xanthographus*、黄蛛甲 (*Niptushololeucus*)、椰蛀犀金龟 (*Oryctes rhinoceros*)、锯谷盗 (*Oryzaephilus surinamensis*)、黑葡萄耳象 (*Otiorrhynchus sulcatus*)、小青花金龟 (*Oxycetonia jucunda*)、辣根猿叶虫 (*Phaedon cochleariae*)、食叶鳃金龟属 (*Phyllophaga* spp.)、日本弧丽金龟 (*Popillia japonica*)、*Premnotrypes* spp.、油菜金头跳甲 (*Psylliodes chrysocephala*)、蛛甲属 (*Ptinus* spp.)、暗色瓢虫 (*Rhizobius ventralis*)、谷蠹 (*Rhizopertha dominica*)、谷象属 (*Sitophilus* spp.)、尖隐喙象属 (*Sphenophorus* spp.)、茎干象属 (*Sternechus* spp.)、*Symphyletes* spp.、黄粉虫 (*Tenebrio molitor*)、拟谷盗属 (*Tribolium* spp.)、斑皮蠹属 (*Trogoderma* spp.)、籽象属 (*Tychius* spp.)、脊虎天牛属 (*Xylotrechus* spp.)、距步甲属 (*Zabrus* spp.)。

[0026] 弹尾目 (Collembola),例如,武装棘跳虫 (*Onychiurus armatus*)。

[0027] 革翅目 (Dermaptera),例如,欧洲球蝮 (*Forficula auricularia*)。

[0028] 倍足目 (Diplopoda),例如, *Blaniulus guttulatus*。

[0029] 双翅目 (Diptera),例如,伊蚊属 (*Aedes* spp.)、按蚊属 (*Anopheles* spp.)、花园毛蚊 (*Bibio hortulanus*)、红头丽蝇 (*Calliphora erythrocephala*)、地中海蜡实蝇 (*Ceratitis capitata*)、金蝇属 (*Chrysomya* spp.)、锥蝇属 (*Cochliomyia* spp.)、*Cordylobia anthropophaga*、库蚊属 (*Culex* spp.)、黄蝇属 (*Cuterebra* spp.)、橄榄大实蝇 (*Dacus oleae*)、人肤蝇 (*Dermatobia hominis*)、果蝇属 (*Drosophila* spp.)、厕蝇属 (*Fannia* spp.)、胃蝇属 (*Gastrophilus* spp.)、黑蝇属 (*Hylemyia* spp.)、*Hyppobosca* spp.、皮蝇属 (*Hypoderma* spp.)、斑潜蝇属 (*Liriomyza* spp.)、绿蝇属 (*Lucilia* spp.)、家蝇属 (*Musca* spp.)、绿蝽属 (*Nezara* spp.)、狂蝇属 (*Oestrus* spp.)、瑞典麦秆蝇 (*Oscinella frit*)、藜泉蝇 (*Pegomyia hyoscyami*)、草种蝇属 (*Phorbia* spp.)、螫蝇属 (*Stomoxys* spp.)、虻属 (*Tabanus* spp.)、*Tannia* spp.、欧洲大蚊 (*Tipula paludosa*)、污蝇

属 (*Wohlfahrtia* spp.)。

[0030] 腹足纲 (*Gastropoda*), 例如, *Arion* spp.、双脐螺属 (*Biomphalaria*spp.)、小泡螺属 (*Bulinus* spp.)、*Deroceras* spp.、土蜗属 (*Galba*spp.)、椎实螺属 (*Lymnaea* spp.)、钉螺属 (*Oncomelania* spp.)、琥珀螺属 (*Succinea* spp.)。

[0031] 蠕虫纲 (*Helminths*), 例如, 十二指肠钩口线虫 (*Ancylostomaduodenale*)、斯里兰卡钩口线虫 (*Ancylostoma ceylanicum*)、巴西钩口线虫 (*Acylostoma braziliensis*)、钩口线虫属 (*Ancylostoma* spp.)、似引蛔线虫 (*Ascaris lubricoides*)、蛔虫属 (*Ascaris* spp.)、马来布鲁线虫 (*Brugia malayi*)、帝汶布鲁线虫 (*Brugia timori*)、仰口线虫属 (*Bunostomum* spp.)、夏柏特线虫属 (*Chabertia* spp.)、枝睾吸虫属 (*Clonorchis* spp.)、古柏线虫属 (*Cooperia* spp.)、双腔吸虫属 (*Dicrocoelium* spp.)、丝状网尾线虫 (*Dictyocaulus filaria*)、阔节裂头绦虫 (*Diphyllobothrium latum*)、麦地那龙线虫 (*Dracunculus medinensis*)、细粒棘球绦虫 (*Echinococcus granulosus*)、多房棘球绦虫 (*Echinococcus multilocularis*)、蠕形住肠蛲虫 (*Enterobius vermicularis*)、*Faciola* spp.、血毛线虫属 (*Haemonchus* spp.)、异刺线虫属 (*Heterakis* spp.)、矮小啮壳绦虫 (*Hymenolepis nana*)、猪圆线虫属 (*Hyostromgulus* spp.)、罗阿罗阿线虫 (*Loa Loa*)、细颈线虫属 (*Nematodirus* spp.)、结节线虫属 (*Oesophagostomum* spp.)、后睾吸虫属 (*Opisthorchis* spp.)、旋盘尾丝虫 (*Onchocerca volvulus*)、奥斯脱线虫属 (*Ostertagia* spp.)、并殖吸虫属 (*Paragonimus* spp.)、*Schistosomen* spp.、富氏类圆线虫 (*Strongyloides fuelleborni*)、粪类圆线虫 (*Strongyloidesstercoralis*)、粪圆线虫属 (*Stronyloides* spp.)、牛带绦虫 (*Taeniasaginata*)、猪带绦虫 (*Taenia solium*)、旋毛形线虫 (*Trichinellaspinalis*)、本地毛形线虫 (*Trichinella nativa*)、株布氏旋毛虫 (*Trichinella britovi*)、南方旋毛虫 (*Trichinella nelsoni*)、*Trichinella pseudopsiralis*、毛圆线虫属 (*Trichostrongulus* spp.)、人鞭虫 (*Trichuris trichuria*)、班氏吴策线虫 (*Wuchereriabancrofti*)。

[0032] 此外, 还可防治原生动植物, 例如艾美虫 (*Eimeria*)。

[0033] 异翅目 (*Heteroptera*), 例如, 南瓜缘蝽 (*Anasa tristis*)、拟丽蝽属 (*Antestiopsis* spp.)、土长蝽属 (*Blissus* spp.)、俊盲蝽属 (*Calocoris* spp.)、*Campylomma livida*、异背长蝽属 (*Cavelerius*spp.)、臭虫属 (*Cimex* spp.)、*Creontiades dilutus*、胡椒缘蝽 (*Dasynuspiperis*)、*Dichelops furcatus*、厚氏长棒网蝽 (*Diconocorishewetti*)、棉红蝽属 (*Dysdercus* spp.)、美洲蝽属 (*Euschistus* spp.)、扁盾蝽属 (*Eurygaster* spp.)、*Heliopeletis* spp.、*Horciasnobilellus*、稻缘蝽属 (*Leptocorisa* spp.)、叶喙缘蝽 (*Leptoglossusphyllopus*)、草盲蝽属 (*Lygus*spp.)、蔗黑长蝽 (*Macropes excavatus*)、盲蝽科 (*Miridae*)、绿蝽属、*Oebalus* spp.、*Pentomidae*、方背皮蝽 (*Piesma quadrata*)、壁蝽属 (*Piezodorus* spp.)、棉伪斑腿盲蝽 (*Psallus seriatus*)、*Pseudacysta persea*、红猎蝽属 (*Rhodnius*spp.)、可可褐盲蝽 (*Sahlbergella singularis*)、黑蝽属 (*Scotinophora* spp.)、梨冠网蝽 (*Stephanitis nashi*)、*Tibracas*spp.、锥猎蝽属 (*Triatoma* spp.)。

[0034] 同翅目 (*Homoptera*), 例如, 无网长管蚜属 (*Acyrtosipon* spp.)、*Aeneolamia* spp.、隆脉木虱属 (*Agonosцена* spp.)、*Aleurodes* spp.、蔗粉虱属 (*Aleurolobus*

barodensis)、Aleurothrixus spp.、杧果叶蝉属 (Amrasca spp.)、Anuraphis cardui、肾圆盾蚧属 (Aonidiellasp.)、苏联黄粉蚜 (Aphanostigma piri)、蚜属 (Aphis spp)、葡萄叶蝉 (Arboridia apicalis)、小圆盾蚧属 (Aspidiella spp.)、圆盾蚧属 (Aspidiotus spp.)、Atanus spp.、茄沟无网蚜 (Aulacorthumsolani)、Bemisia spp.、李短尾蚜 (Brachycaudus helichrysi)、Brachycolus spp.、甘蓝蚜 (Brevicoryne brassicae)、小褐稻虱 (Caligiopona marginata)、Carniolella fulvipes、甘蔗粉角蚜 (Ceratovacuna lanigera)、沫蝉科 (Cercopidae)、蜡蚧属 (Ceroplastes spp.)、草莓钉蚜 (Chaetosiphon fragaefolii)、蔗黄雪盾蚧 (Chionaspis tegalensis)、茶绿叶蝉 (Chlorita onukii)、核桃黑斑蚜 (Chromaphis juglandicola)、黑褐圆盾蚧 (Chrysomphalus ficus)、玉米叶蝉 (Cicadulina mbila)、Coccomytilus halli、软蚧属 (Coccus spp.)、茶蔗隐瘤蚜 (Cryptomyzus ribis)、Dalbulus spp.、Dialeurodes spp.、Diaphorina spp.、白背盾蚧属 (Diaspis spp.)、Doralis spp.、履绵蚧属 (Drosicha spp.)、西圆尾蚜属 (Dysaphis spp.)、灰粉蚧属 (Dysmicoccus spp.)、小绿叶蝉属 (Empoasca spp.)、绵蚜属 (Eriosoma spp.)、Erythroneura spp.、Euscelis bilobatus、咖啡地粉蚧 (Geococcus coffeae)、假桃病毒叶蝉 (Homalodisca coagulata)、梅大尾蚜 (Hyalopterus arundinis)、吹绵蚧属 (Icerya spp.)、片角叶蝉属 (Idiocerus spp.)、扁喙叶蝉属 (Idioscopus spp.)、灰飞虱 (Laodelphax striatellus)、Lecanium spp.、蛎盾蚧属 (Lepidosaphes spp.)、萝卜蚜 (Lipaphis erysimi)、长管蚜属 (Macrosiphum spp.)、Mahanarva fimbriolata、高粱蚜 (Melanaphis sacchari)、Metcalfiella spp.、麦无网蚜 (Metopolophium dirhodum)、黑缘平翅斑蚜 (Monellia costalis)、Monelliopsis pecanis、瘤蚜属 (Myzus spp.)、莴苣长管蚜 (Nasonovia ribisnigri)、黑尾叶蝉属 (Nephotettix spp.)、褐飞虱 (Nilaparvata lugens)、Oncometopia spp.、Orthezia praelonga、杨梅缘粉虱 (Parabemisia myricae)、Paratrioza spp.、片盾蚧属 (Parlatoria spp.)、瘿绵蚜属 (Pemphigus spp.)、玉米蜡蝉 (Peregrinus maidis)、绵粉蚧属 (Phenacoccus spp.)、杨平翅绵蚜 (Phloeomyzus passerinii)、忽布疣蚜 (Phorodon humuli)、Phylloxera spp.、苏铁褐点并盾蚧 (Pinnaspis aspidistrae)、臀纹粉蚧属 (Planococcus spp.)、梨形原绵蚧 (Protopulvinariapyriformis)、桑白盾蚧 (Pseudaulacaspis pentagona)、粉蚧属 (Pseudococcus spp.)、木虱属 (Psylla spp.)、金小蜂属 (Pteromalus spp.)、Pyrilla spp.、笠圆盾蚧属 (Quadraspidotus spp.)、Quesadagigas、平刺粉蚧属 (Rastrococcus spp.)、缢管蚜属 (Rhopalosiphum spp.)、黑盔蚧属 (Saissetia spp.)、Scaphoides titanus、麦二叉蚜 (Schizaphis graminum)、苏铁刺圆盾蚧 (Selenaspidus articulatus)、长唇基飞虱属 (Sogatella furcifera)、Sogatodes spp.、Stictocephala festina、Tenalapha malayensis、Tinocallis caryaefoliae、广胸沫蝉属 (Tomaspis spp.)、声蚜属 (Toxoptera spp.)、温室粉虱 (Trialeurodes vaporariorum)、个木虱属 (Trioxys spp.)、小叶蝉属 (Typhlocyba spp.)、尖盾蚧属 (Unaspis spp.)、Viteus vitifolii。

[0035] 膜翅目 (Hymenoptera), 例如, 松叶蜂属 (Diprion spp.)、实叶蜂属 (Hoplocampa spp.)、毛蚁属 (Lasius spp.)、小家蚁 (Monomorium pharaonis)、胡蜂属 (Vespa spp.)。

[0036] 等足目 (Isopoda), 例如, 鼠妇 (Armadillidium vulgare)、栉水虱 (Oniscus

asellus)、球鼠妇 (*Porcellio scaber*)。

[0037] 等翅目 (Isoptera), 例如, 散白蚁属 (*Reticulitermes* spp.)、土白蚁属 (*Odontotermes* spp.)。

[0038] 鳞翅目 (Lepidoptera), 例如, 桑剑纹夜蛾 (*Acronicta major*)、烦夜蛾 (*Aedia leucomelas*)、地老虎属 (*Agrotis* spp.)、棉叶波纹夜蛾 (*Alabama argillacea*)、干煞夜蛾属 (*Anticarsia* spp.)、*Barathrabrassicae*、棉潜蛾 (*Bucculatrix thurberiella*)、松尺蠖 (*Bupaluspiniarius*)、亚麻黄卷蛾 (*Cacoecia podana*)、*Capua reticulana*、苹果小卷蛾 (*Carpocapsa pomonella*)、冬尺蛾 (*Cheimatobia brumata*)、禾草螟属 (*Chilo* spp.)、枞色卷蛾 (*Choristoneura fumiferana*)、葡萄果蠹蛾 (*Clysia ambiguella*)、*Cnaphalocerus* spp.、埃及金刚钻 (*Earias insulana*)、地中海粉斑螟 (*Ephestia kuehniella*)、黄毒蛾 (*Euproctis chrysorrhoea*)、切根虫属 (*Euxoa* spp.)、脏切夜蛾属 (*Feltia* spp.)、大蜡螟 (*Galleria mellonella*)、*Helicoverpa* spp.、实夜蛾属 (*Heliothis* spp.)、褐织蛾 (*Hofmannophilapseudospretella*)、茶长卷蛾 (*Homona magnanima*)、苹果巢蛾 (*Hyponomeuta padella*)、贪夜蛾属 (*Laphygma* spp.)、苹细蛾 (*Lithocolletis blancardella*)、绿果冬夜蛾 (*Lithophaneantennata*)、豆白隆切根虫 (*Loxagrotis albicosta*)、毒蛾属 (*Lymantria* spp.)、黄褐天幕毛虫 (*Malacosoma neustria*)、甘蓝夜蛾 (*Mamestra brassicae*)、稻毛胫夜蛾 (*Mocis repanda*)、粘虫 (*Mythimna separata*)、*Oria* spp.、水稻负泥虫 (*Oulema oryzae*)、小眼夜蛾 (*Panolis flammea*)、红铃麦蛾 (*Pectinophora gossypiella*)、桔潜蛾 (*Phyllocnistis citrella*)、菜粉蝶属 (*Pieris* spp.)、菜蛾 (*Plutella xylostella*)、斜纹夜蛾属 (*Prodenia* spp.)、*Pseudaletia* spp.、大豆夜蛾 (*Pseudoplusia includens*)、玉米螟 (*Pyraustanubilalis*)、灰翅夜蛾属 (*Spodoptera* spp.)、*Thermesia gemmatilis*、袋谷蛾 (*Tinea pellionella*)、幕谷蛾 (*Tineola bisselliella*)、栎绿卷蛾 (*Tortrix viridana*)、粉夜蛾属 (*Trichoplusia* spp.)。

[0039] 直翅目 (Orthoptera), 例如, 家蟋 (*Acheta domesticus*)、东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*)、德国蠊 (*Blattella germanica*)、蝼蛄属 (*Gryllotalpa* spp.)、马德拉蜚蠊 (*Leucophaea maderae*)、飞蝗属 (*Locusta* spp.)、黑蝗属 (*Melanoplus* spp.)、美洲大蠊 (*Periplaneta americana*)、沙漠蝗 (*Schistocerca gregaria*)。

[0040] 蚤目 (Siphonaptera), 例如, 角叶蚤属 (*Ceratophyllus* spp.)、印鼠客蚤 (*Xenopsylla cheopis*)。

[0041] 综合目 (Symphyla), 例如, *Scutigera* *immaculata*。

[0042] 缨翅目 (Thysanoptera), 例如, 稻蓟马 (*Baliothrips bififormis*)、*Enneothrips flavens*、花蓟马属 (*Frankliniella* spp.)、网蓟马属 (*Heliothrips* spp.)、温室条蓟马 (*Hercinothrips femoralis*)、卡蓟马属 (*Kakothrips* spp.)、葡萄蓟马 (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、硬蓟马属 (*Scirtothrips* spp.)、*Taeniothrips cardamoni*、蓟马属 (*Thrips* spp.)。

[0043] 缨尾目 (Thysanura), 例如, 衣鱼 (*Lepisma saccharina*)。

[0044] 植物寄生线虫包括, 例如, 鳗线虫属 (*Anguina* spp.)、滑刃线虫属 (*Aphelenchoides* spp.)、刺线虫属 (*Belonoaimus* spp.)、伞滑刃线虫属 (*Bursaphelenchus*

spp.)、起绒草茎线虫 (*Ditylenchus dipsaci*)、球异皮线虫属 (*Globodera* spp.)、螺旋线虫属 (*Heliocotylenchus* spp.)、异皮线虫属 (*Heterodera* spp.)、长针线虫属 (*Longidorus* spp.)、根结线虫属 (*Meloidogyne* spp.)、短体线虫属 (*Pratylenchus* spp.)、相似穿孔线虫 (*Radopholus similis*)、小盘旋线虫属 (*Rotylenchus* spp.)、毛刺线虫属 (*Trichodorus* spp.)、矮化线虫属 (*Tylenchorhynchus* spp.)、小垫刃线虫属 (*Tylenchulus* spp.)、半穿刺线虫 (*Tylenchulus semipenetrans*)、剑线虫属 (*Xiphinema* spp.)。

[0045] 如果合适,本发明的活性化合物结合物也可以一定浓度或施用率用作除草剂、安全剂、生长调节剂,或者用作改善植物特性的药剂,或者用作杀微生物剂,例如杀真菌剂、抗霉剂、杀细菌剂、杀病毒剂(包括抵抗类病毒的药剂)或用作抵抗 MLO(类支原体)和 RLO(类立克次氏体)的药剂。如果合适,它们也可用作合成其它活性化合物的中间体或前体。

[0046] 所有的植物及植物部位均可依据本发明予以处理。本发明中植物的含义应理解为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(包括天然存在的作物植物)。作物植物可为可通过常规植物育种和优选法或通过生物技术和遗传工程方法或通过前述方法的结合而获得的植物,包括转基因植物,也包括受植物种苗权保护或不受其保护的植物栽培种。植物部位的含义应理解为植物所有的地上及地下部位及器官,例如芽、叶、花和根,可提及的实例为叶、针叶、茎、干、花、子实体、果实和种子,以及根、块茎和根茎。植物部位还包括采收物以及无性与有性繁殖物,例如插枝、块茎、根茎、分株和种子。

[0047] 根据本发明使用活性化合物结合物对植物和植物部位进行的处理通过常规处理方法直接进行或者通过使化合物作用于其所处环境、生境或储存空间来实现,所述常规处理方法例如浸液、喷雾、蒸发、弥雾、撒播、涂抹、注射,并且,对于繁殖材料,尤其是种子,还可包衣一层或多层。

[0048] 本发明的活性化合物结合物特别适合用于处理种子。此处,上文中提及的优选的或特别优选的本发明结合物可被作为优选的而提及。因此,大部分由害虫引起的对作物植物造成的损害早在种子贮藏期间、种子播入土壤之后、以及植物萌芽期间和刚萌芽之后受到侵扰时就发生了。该阶段特别关键,因为正在生长植物的根和芽特别敏感,即使是很小量的伤害也能导致整株植物的死亡。因此,通过使用合适的组合物来保护种子和正在萌芽的植物具有特别重大的意义。

[0049] 通过处理植物种子来防治害虫长时间以来就已知了,并且它也是不断改进的主题。然而,种子的处理通常存在许多不能总是以令人满意的方式解决的问题。因此,需要开发不必在播种后或植物出苗后另外施用作物保护剂而保护种子和正在萌芽的植物的方法。此外,还需要优化活性化合物的用量以向种子和正在萌芽的植物提供最好保护以免受害虫的侵袭、同时又不会由于所使用的活性化合物而伤害植物本身。特别地,种子处理方法也应当考虑到转基因植物所固有的杀虫性能,以便通过使用最少的作物保护剂获得对种子和正在萌芽的植物的最佳保护。

[0050] 因此,本发明还特别涉及一种保护种子和正在萌芽的植物免受害虫侵袭的方法,该方法包括用本发明的活性化合物结合物处理种子。本发明的用于保护种子和正在萌芽的植物免受害虫侵袭的方法包括用一种式 I 活性化合物和噻虫胺同时处理种子的方法。本发明还包括一种用一种式 I 活性化合物和噻虫胺在不同时间处理种子的方法。本发明还涉及

本发明活性化合物结合物用于处理种子以保护种子和由其萌芽的植物免受害虫侵袭的用途。此外,本发明还涉及经本发明的活性化合物结合物处理以保护其免受害虫侵袭的种子。本发明还涉及经一种式 I 活性化合物和噻虫胺同时处理过的种子。此外,本发明还涉及经一种式 I 活性化合物和噻虫胺在不同时间处理的种子。对于经一种式 I 活性化合物和噻虫胺在不同时间处理的种子的情况,本发明组合中各活性化合物可存在于种子的不同包衣层内。此处,含有一种式 I 活性化合物和含有噻虫胺的包衣层可任选地被一个中间层隔开。本发明还涉及这样的种子,其中一种式 I 活性化合物和噻虫胺作为包衣层的组分或作为除一个包衣层以外的另一层或多层施用。

[0051] 本发明的优点之一在于,本发明的活性化合物结合物的特别的内吸性能意味着用这些活性化合物结合物处理种子不仅保护了种子自身,而且还保护了出苗后的植物免受害虫侵袭。以该方式,可省去在播种时或此后较短时间内对作物的立刻处理。

[0052] 另一个优点在于,本发明的活性化合物结合物与单独的杀虫活性化合物相比具有协同增加的杀虫活性,该活性超过了单独施用的这两种活性化合物的活性总和。同样有利的是,本发明的活性化合物结合物与单独的杀虫活性化合物相比具有协同增加的杀虫活性,该活性超过了单独施用的活性化合物的活性总和。这使得优化活性化合物的用量成为可能。

[0053] 还应视为优点的是,本发明的活性化合物结合物也可特别用于转基因种子,由这种转基因种子长出的植物能表达一种针对害虫的蛋白。通过用本发明的活性化合物结合物处理上述种子,仅通过例如杀虫蛋白的表达即可防治某些害虫,并且另外可由本发明的活性化合物结合物保护免受损害。

[0054] 本发明的活性化合物结合物适于保护用于农业、温室、林业或园艺中的上文提及的任何植物品种的种子。具体而言,上述种子涉及以下植物的种子:玉米、花生、加拿大油菜、油菜、罂粟、大豆、棉花、甜菜(例如糖用甜菜和饲用甜菜)、稻、高粱和粟、小麦、大麦、燕麦、黑麦、向日葵、烟草、马铃薯或蔬菜(例如番茄、甘蓝植物)。本发明的活性化合物结合物也适用于处理前面已经提及的果实植物和蔬菜的种子。特别重要的是对玉米、大豆、棉花、小麦和加拿大油菜或油菜的种子进行的处理。

[0055] 如上所述,用本发明的活性化合物结合物处理转基因种子也特别重要。这涉及通常包含至少一种支配着具有特别是杀虫性能的多肽表达的异源基因的植物种子。本文中,转基因种子中的异源基因可来自于微生物,例如芽孢杆菌(*Bacillus*)、根瘤菌(*Rhizobium*)、假单细胞菌(*Pseudomonas*)、沙雷氏菌(*Serratia*)、木霉(*Trichoderma*)、棍状杆菌(*Clavibacter*)、球囊霉菌(*Glomus*)或粘帚霉(*Gliocladium*)。本发明特别适于处理这样的转基因种子,该转基因种子包含至少一种源于芽孢杆菌属(*Bacillus* sp.)的异源基因并且其基因产物表现出抗欧洲玉米螟(*European corn borer*)和/或玉米根蠕虫(*cornrootworm*)的活性。特别优选来自于苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*)的异源基因。

[0056] 本发明中,本发明的活性化合物结合物可单独或以合适的制剂形式施用于种子。优选地,在种子稳定得足以在处理中不受损害的状态下对其进行处理。一般而言,可在采收和播种之间的任何时间点处理种子。通常所用的种子已与植物相分离,并且已脱离穗轴、壳、茎、表皮、毛或果肉。

[0057] 处理种子时,一般必须注意,施用于种子的本发明活性化合物结合物的量和/或其它添加剂的量应选择为对种子的萌发没有有害作用或者不伤害长出的植物。尤其是在活性化合物于某些施用率下可能具有植物毒性效应的情况下,必须注意这一点。

[0058] 本发明的活性化合物结合物可转化为常规制剂,例如溶液剂、乳剂、可湿性粉剂、水基和油基悬浮剂、粉剂、粉末剂、膏剂、可溶性粉剂、可溶性颗粒剂、撒播用颗粒剂、悬乳浓缩剂、经活性化合物浸渍的天然材料、经活性化合物浸渍的合成材料、肥料以及聚合物中的微胶囊剂。

[0059] 这些制剂以已知的方式制成,例如将活性化合物与填充剂混合,即,与液体溶剂和/或固体载体混合;同时任选地使用表面活性剂,即乳化剂和/或分散剂和/或发泡剂。这些制剂可在适当的装置中制备,或者在施用之前或施用期间制备。

[0060] 适用作助剂的是适用于赋予活性化合物结合物本身和/或由其得到的制剂(例如喷洒液、拌种剂)以特殊性能——如某些技术特性和/或特定的生物学性能——的物质。典型的合适的助剂有:填充剂、溶剂和载体。

[0061] 合适的填充剂为,例如,水;极性的和非极性的有机化学液体,例如属于芳香烃和非芳香烃类(如石蜡、烷基苯、烷基萘、氯苯)、醇类和多元醇类(如果合适,可以是被取代的、醚化的和/或酯化的)、酮类(如丙酮、环己酮)、酯类(包括脂肪和油类)以及(聚)醚类、未取代的和取代的胺类、酰胺类、内酰胺类(如N-烷基吡咯烷酮)和内酯类、砜类和亚砜类(如二甲亚砜)的极性的和非极性的有机化学液体。

[0062] 如果使用水作为填充剂,还可使用例如有机溶剂作为助溶剂。合适的液体溶剂主要有:芳香族化合物,例如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯化芳烃和氯代脂族烃,例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,例如环己烷或石蜡,如石油馏分、矿物油和植物油;醇,例如丁醇或乙二醇,及它们的醚和酯;酮,例如丙酮、甲乙酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂如二甲亚砜;以及水。

[0063] 适合的固体载体为:

[0064] 例如,铵盐;和粉碎的天然矿物,例如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、凹凸棒石、蒙脱石或硅藻土;以及粉碎的合成矿物,例如高度分散的二氧化硅、氧化铝和硅酸盐;适用于颗粒剂的固体载体为:例如粉碎并分级的天然岩石,例如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石;及无机和有机粉末的合成颗粒,以及有机物质的颗粒,例如纸、锯屑、椰壳、玉米穗轴和烟草茎;适合的乳化剂和/或发泡剂为:例如非离子和阴离子乳化剂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;及蛋白质水解产物;适合的分散剂为非离子型和/或离子型物质,例如属于以下类别的物质:醇-POE-和/或-POP-醚,酸和/或POP-POE酯,烷基芳基和/或POP-POE醚,脂肪-和/或POP-POE加合物,POE-和/或POP-多元醇衍生物,POE-和/或POP-脱水山梨醇-或-糖加合物,烷基或芳基硫酸酯,烷基或芳基磺酸酯,以及烷基或芳基磷酸酯或者相应的PO-醚加合物。此外,还有合适的低聚物或高聚物,例如由乙烯单体形成的、由丙烯酸形成的低聚物或高聚物,由EO和/或PO单独形成的或与如(多元)醇或(多)胺共同形成的低聚物或高聚物。还可采用木质素及其磺酸衍生物、未改性的和改性的纤维素、芳香族和/或脂族磺酸及它们与甲醛的加合物。

[0065] 制剂中可使用增粘剂,例如羧甲基纤维素;以及粉末、颗粒或胶乳状的天然及合成

聚合物,例如阿拉伯树胶、聚乙烯醇及聚乙酸乙烯酯;以及天然磷脂,例如脑磷脂和卵磷脂,以及合成磷脂。

[0066] 可使用着色剂,例如无机颜料如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝,有机染料如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料,以及微量营养物如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐。

[0067] 其它可能的添加剂有香料、任选改性的矿物油或植物油、蜡和营养物(包括微量营养物)如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐。

[0068] 还可含有稳定剂,例如低温稳定剂、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂或者其它改进化学和/或物理稳定性的试剂。

[0069] 制剂通常包括 0.01 至 98 重量%、优选 0.5 至 90 重量%的活性化合物。

[0070] 市售制剂形式及由该制剂制备的使用形式的本发明的活性化合物结合物可存在于与其它活性化合物的混合物中,所述其它活性化合物例如杀昆虫剂、引诱剂、消毒剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、生长调节剂或除草剂。所述杀昆虫剂包括,例如磷酸酯类、氨基甲酸酯类、羧酸酯类、氯代烃类、苯基脲类、由微生物产生的物质等。

[0071] 还可与其它已知活性化合物例如除草剂或肥料以及生长调节剂混合。

[0072] 当用作杀虫剂时,本发明的活性化合物结合物还可以其市售制剂和由所述制剂制备的使用形式作为与增效剂的混合物存在。增效剂为提高活性化合物活性、而所加入的增效剂本身不一定具有活性的化合物。

[0073] 由市售制剂制备的使用形式的活性化合物含量可在较宽的范围内变化。使用形式的活性化合物浓度可为 0.00000001 至 95 重量%的活性化合物,优选 0.00001 至 1 重量%。

[0074] 施用以适合于使用形式的方式进行。

[0075] 如上所述,可依据本发明处理所有的植物和其部位。在一个优选实施方案中,处理了野生植物种和植物栽培种、或者由常规生物育种方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,处理了由遗传工程方法、如果合适还可与常规方法相结合而获得的转基因植物和植物栽培种(遗传修饰生物)及其部位。术语“部位”或“植物的部位”或“植物部位”解释如上。

[0076] 特别优选依据本发明对各自被市售或使用的植物栽培种的植物进行处理。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、生物型(biotype)或基因型形式。

[0077] 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、营养生长期、营养(diet)),本发明的处理也可产生超加和性(“协同”)效应。由此可获得如下超过实际预期的效果,例如可降低可根据本发明使用的物质和组合物的施用率和/或拓宽其活性谱和/或提高其活性、改善植物生长状况、提高高温或低温耐受性、提高对干旱或者对水中或土壤中含盐量的耐受性、提高开花品质、使采收更简易、加速成熟、提高采收产率、提高采收产物的品质和/或提高其营养价值、改善采收产物的贮存稳定性和/或其加工性能。

[0078] 优选的依据本发明处理的转基因植物或植物栽培种(通过遗传工程方法获得)包括通过遗传修饰而接受遗传物质的所有植物,所述遗传物质将特别有利的、有用的特征赋予这些植物。这些特征的实例有改善植物生长状况、提高高温或低温耐受性、提高对干旱或者对水中或土壤中含盐量的耐受性、提高开花品质、使采收更简易、加速成熟、提高采收产

率、提高采收产物的品质和 / 或提高其营养价值、改善采收产物的贮存稳定性和 / 或其加工性能。所述特征的需另外特别强调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。可提出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、甜菜、番茄、豌豆以及其它蔬菜品种、棉花、烟草、油菜和果实植物(果实为苹果、梨、柑橘类果实和葡萄),特别强调的是玉米、大豆、马铃薯、棉花、烟草和油菜。强调的特征特别为通过在植物体内形成毒素,特别是由苏云金杆菌的遗传物质(例如由基因 CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb 和 CryIF 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、蛞蝓和蜗牛的抵抗力(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、刺激素(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。此外还特别强调的特征为提高植物对某些除草活性化合物例如咪唑啉酮类、磺酰脲类、草甘膦或膦基麦黄酮(phosphinotricin)(例如“PAT”基因)的耐受性。赋予所述所想要特征的基因也可在转基因植物体内相互结合而存在。可提出的“Bt 植物”的实例为市售的商标名称为 YIELD **GARD®**(例如玉米、棉花、大豆)、**KnockOut®**(例如玉米)、**StarLink®**(例如玉米)、**Bollgard®**(棉花)、**Nucotn®**(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。可提出的具有除草剂耐受性的植物的实例为市售的商标名称为 Roundup **Ready®**(具有草甘膦耐受性,例如玉米、棉花、大豆)、Liberty **Link®**(具有膦基麦黄酮耐受性,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。可提出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)包括名为**Clearfield®**的市售品种(例如玉米)。当然,以上叙述也适用于具有所述或仍待开发的遗传特征的植物栽培种,所述植物栽培种将在未来进行开发和 / 或上市。

[0079] 所列植物可以特别有利的方式用本发明的活性化合物结合物进行处理。活性化合物结合物的上述优选范围也适用于对这些植物的处理。特别强调的为用本发明特别提及的活性化合物结合物对植物进行处理。

[0080] 本发明的活性化合物结合物不仅对植物有害物、卫生有害物和贮存产品有害物具有活性,而且在兽医领域对动物寄生虫(体外寄生虫和体内寄生虫)例如硬蜱、软蜱、疥螨、叶螨、蝇(叮咬和吸食)、寄生蝇幼虫、虱、毛虱、羽虱和蚤也具有活性。这些寄生虫包括:

[0081] 虱目(Anoplurida),例如血虱属(Haematopinus spp.)、毛虱属(Linognathus spp.)、虱属(Pediculus spp.)、Phtirus spp.、管虱属(Solenopotes spp.)。

[0082] 食毛目(Mallophagida)及钝角亚目(Amblycerina)和细角亚目(Ischnocerina),例如毛羽虱属(Trimenopon spp.)、禽虱属(Menoponspp.)、巨羽虱属(Trinoton spp.)、牛羽虱属(Bovicola spp.)、Werneckiella spp.、Lepikentron spp.、畜虱属(Damalina spp.)、嚼虱属(Trichodectes spp.)、猫羽虱属(Felicola spp.)。

[0083] 双翅目及长角亚目(Nematocerina)和短角亚目(Brachycerina),例如伊蚊属、按蚊属、库蚊属、蚋属(Simulium spp.)、真蚋属(Eusimulium spp.)、白蛉属(Phlebotomus spp.)、罗蛉属(Lutzomyiaspp.)、库蠓属(Culicoides spp.)、斑虻属(Chrysops spp.)、瘤虻属(Hybomitra spp.)、黄虻属(Atylotus spp.)、虻属、麻虻属(Haematopota spp.)、

Philipomyia spp.、蜂虱蝇属 (Braula spp.)、家蝇属、齿股蝇属 (Hydrotaea spp.)、螫蝇属 (Stomoxys spp.)、黑角蝇属 (Haematobia spp.)、莫蝇属 (Morellia spp.)、厩蝇属、舌蝇属 (Glossina spp.)、丽蝇属 (Calliphora spp.)、绿蝇属、金蝇属、污蝇属、麻蝇属 (Sarcophaga spp.)、狂蝇属、皮蝇属、胃蝇属、虱蝇属 (Hippobosca spp.)、羊虱蝇属 (Lipoptena spp.)、蜱蝇属 (Melophagus spp.)。

[0084] 蚤目 (Siphonapterida), 例如蚤属 (Pulex spp.)、栉首蚤属 (Ctenocephalides spp.)、客蚤属 (Xenopsylla spp.)、角叶蚤属 (Ceratophyllus spp.)。

[0085] 异翅目 (Heteropterida), 例如臭虫属、锥猎蝽属、红猎蝽属、锥蝽属 (Panstrongylus spp.)。

[0086] 蜚蠊目 (Blattarida), 例如东方蜚蠊、美洲大蠊、德国蠊、夏柏拉蟑螂属 (Supella spp.)。

[0087] 蜱螨亚纲 (Acari 或 Acarina) 及后气门目 (Metastigmate) 和中气门目 (Mesostigmata), 例如锐缘蜱属、钝缘蜱属 (Ornithodoros spp.)、残喙蜱属 (Otobius spp.)、硬蜱属、花蜱属、牛蜱属、革蜱属 (Dermacentor spp.)、Haemophysalis spp.、璃眼蜱属、扇头蜱属、皮刺螨属 (Dermanyssus spp.)、刺利螨属 (Raillietia spp.)、肺刺螨属 (Pneumonyssus spp.)、胸刺螨属 (Sternostoma spp.)、蜂螨属 (Varroa spp.)。

[0088] 轴螨目 (Actiniedida) (前气门亚目 (Prostigmata)) 和粉螨目 (Acaridida) (无气门亚目 (Astigmata)), 例如蜂盾螨属 (Acarapisspp.)、姬螯螨属 (Cheyletiella spp.)、禽螯螨属 (Ornithocheyletiasspp.)、肉螨属 (Myobia spp.)、疮螨属 (Psorergates spp.)、蠕形螨属 (Demodex spp.)、恙螨属 (Trombicula spp.)、Listrophorus spp.、粉螨属 (Acarus spp.)、食酪螨属 (Tyrophagus spp.)、嗜木螨属 (Caloglyphus spp.)、颈下螨属 (Hypodectes spp.)、翅螨属 (Pterolichus spp.)、痒螨属、皮螨属、耳疥螨属 (Otodectes spp.)、疥螨属、耳螨属 (Notoedres spp.)、疙螨属 (Knemidocoptes spp.)、气囊螨属 (Cytodites spp.)、鸡雏螨属 (Laminosioptes spp.)。

[0089] 本发明的活性化合物结合物也适用于防治侵袭以下动物的节肢动物: 农业生产家畜, 例如黄牛、绵羊、山羊、马、猪、驴、骆驼、水牛、兔、家鸡、火鸡、鸭、鹅、蜜蜂; 其它玩赏动物, 例如狗、猫、笼鸟、观赏鱼; 以及所谓的试验动物, 例如仓鼠、豚鼠、大鼠和小鼠。通过防治所述节肢动物, 可减少死亡和 (肉、奶、毛、皮、蛋、蜜等的) 产量降低的情况, 从而可通过使用本发明的活性化合物结合物使畜牧更经济、更简便。

[0090] 本发明的活性化合物结合物以已知方式通过以下方法用于兽医领域和畜牧中: 通过例如片剂、胶囊剂、口服饮剂、兽用顿服药、颗粒剂、膏剂、丸剂、喂服 (feed-through) 法和栓剂的形式进行肠内给药, 通过例如注射 (肌内、皮下、静脉、腹膜内等)、植入物的方式进行肠外给药, 可鼻部给药, 可通过例如浸泡或沐浴、喷雾、泼浇和点滴、清洗、撒粉的形式, 以及借助于包括活性化合物的模型制品如项圈、耳标、尾标、肢体缚带 (limb band)、笼头、标识器等进行皮肤给药。

[0091] 用于家畜、家禽、玩赏动物等时, 活性化合物结合物可以包括 1 至 80 重量% 的活性化合物的制剂 (例如粉剂、乳剂、可流动组合物) 形式直接使用或稀释 100 至 10000 倍后使用, 或可以化学药浴剂 (chemical bath) 形式使用。

[0092] 而且, 已发现本发明的活性化合物结合物还对毁坏工业材料的昆虫具有强杀昆虫

作用。

[0093] 以实例并且优选但不进行任何限制的方式可提出以下昆虫：

[0094] 甲虫,例如北美家天牛、*Chlorophorus pilosis*、家具窃蠹、报死窃蠹 (*Xestobium rufovillosum*)、梳角细脉窃蠹 (*Ptilinuspecticornis*)、*Dendrobium pertinex*、松窃蠹 (*Ernobius mollis*)、*Priobium carpini*、褐粉蠹 (*Lyctus brunneus*)、非洲粉蠹 (*Lyctusafricanus*)、南方粉蠹 (*Lyctus planicollis*)、栎粉蠹 (*Lyctuslinearis*)、柔毛粉蠹 (*Lyctus pubescens*)、*Trogoxylon aequale*、鳞毛粉蠹 (*Minthes rugicollis*)、材小蠹种 (*Xyleborus spec.*)、*Tryptodendron spec.*、咖啡黑长蠹 (*Apate monachus*)、榭长蠹 (*Bostrychus capucins*)、褐异翅长蠹 (*Heterobostrychus brunneus*)、棘长蠹种 (*Sinoxylon spec.*)、竹长蠹 (*Dinoderus minutus*)；

[0095] 革翅目昆虫 (*Hymenopteron*)，例如大树蜂 (*Sirex juvenicus*)、枞大树蜂 (*Urocerus gigas*)、泰加大树蜂 (*Urocerusgi gas taignus*)、*Urocerus augur*；

[0096] 白蚁,例如欧洲木白蚁 (*Kaloterms flavicollis*)、麻头堆砂白蚁 (*Cryptoterms brevis*)、灰点异白蚁 (*Heteroterms indicola*)、欧美散白蚁 (*Reticuliterms flavipes*)、桑特散白蚁 (*Reticuliterms santonensis*)、南欧网纹白蚁 (*Reticulitermslucifugus*)、达尔文澳白蚁 (*Mastoterms darwiniensis*)、内华达古白蚁 (*Zootermopsis nevadensis*)、家白蚁 (*Coptotermsformosanus*)；

[0097] 蠹虫 (*Bristletail*)，例如衣鱼。

[0098] 在此工业材料的含义应理解为非活体材料,例如,优选为塑料、粘合剂、胶料、纸张和板材、皮革、木材和加工后的木材制品和涂料组合物。

[0099] 即用的组合物,如果合适,还可包括杀虫剂；并且如果合适,还可包括一种或多种杀菌剂。

[0100] 对于可能的其它添加剂,可参考上文提及的杀虫剂和杀菌剂。

[0101] 本发明的活性化合物结合物可同样被用于保护与海水或微咸水接触的物体,例如船体、筛、网、建筑物、系泊设备及信号系统,以防产生污垢。

[0102] 此外,本发明的活性化合物结合物可单独或与其它活性化合物结合用作防污剂。

[0103] 在家庭、卫生和储存产品保护中,所述活性化合物结合物亦适合用于防治封闭空间内发现的动物有害物,特别是昆虫、蛛形纲动物和螨虫,所述封闭空间例如住所、工厂车间、办公室、交通工具舱室等。它们可单独或与其他活性化合物和助剂结合用于防治所述害虫的家用杀虫产品中。它们对敏感和抗性物种以及全部发育阶段均具有活性。这些害虫包括：

[0104] 蝎目 (*Scorpionidea*)，例如地中海黄蝎 (*Buthus occitanus*)。

[0105] 蜱螨目,例如波斯锐缘蜱 (*Argas persicus*)、鸽锐缘蜱 (*Argasreflexus*)、苔螨亚种 (*Bryobia ssp.*)、鸡皮刺螨、家嗜甜螨 (*Glyciphagus domesticus*)、非洲钝缘蜱 (*Ornithodoros moubat*)、血红扇头蜱 (*Rhipicephalus sanguineus*)、阿氏真恙螨 (*Trombiculaalfreddugesi*)、*Neutrombicul aautumnalis*、特嗜皮螨 (*Dermatophagoides pteronissimus*)、法嗜皮螨 (*Dermatophagoidesforinae*)。

[0106] 蜘蛛目 (*Araneae*)，例如捕鸟蛛 (*Aviculariidae*)、圆蛛 (*Araneidae*)。

[0107] 盲蛛目 (*Opiliones*)，例如螯蝎 (*Pseudoscorpiones chelifera*)、

Pseudoscorpiones cheiridium、长跗盲蛛 (Opiliones phalangium)。

[0108] 等足目,例如栉水虱、球鼠妇。

[0109] 倍足目,例如 *Blaniulus guttulatus*、山蛰虫 (*Polydesmus* spp.)。

[0110] 唇足目,例如地蜈蚣属。

[0111] 衣鱼目 (*Zygentoma*), 例如栉衣鱼属 (*Ctenolepisma* spp.)、衣鱼、盗火虫 (*Lepismodes inquilinus*)。

[0112] 蜚蠊目,例如东方蜚蠊、德国蠊、亚洲蠊 (*Blattella asahinai*)、马德拉蜚蠊、角腹蠊属 (*Panchlora* spp.)、木蠊属 (*Parcoblatta* spp.)、澳洲大蠊 (*Periplaneta australasiae*)、美洲大蠊、大褐大蠊 (*Periplaneta brunnea*)、烟色大蠊 (*Periplaneta fuliginosa*)、棕带蜚蠊 (*Supella longipalpa*)。

[0113] 跳跃亚目 (*Saltatoria*), 例如家蟋。

[0114] 革翅目,例如欧洲球螋。

[0115] 等翅目,例如木白蚁属 (*Kaloterms* spp.)、散白蚁属。

[0116] 啮虫目 (*Psocoptera*), 例如 *Lepinatus* spp.、粉啮虫属 (*Liposcelis* spp.)。

[0117] 鞘翅目,例如圆皮蠹属、毛皮蠹属、皮蠹属、长头谷盗 (*Latheticusoryzae*)、隐跗郭公虫属 (*Necrobia* spp.)、蛛甲属、谷蠹、谷象 (*Sitophilus granarius*)、米象 (*Sitophilus oryzae*)、玉米象 (*Sitophilus zeamais*)、药材甲 (*Stegobium paniceum*)。

[0118] 双翅目,例如埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*)、白纹伊蚊 (*Aedes albopictus*)、带喙伊蚊 (*Aedes taeniorhynchus*)、按蚊属、红头丽蝇、高额麻虻 (*Chrysozona pluvialis*)、五带淡色库蚊 (*Culex quinquefasciatus*)、尖音库蚊 (*Culex pipiens*)、环喙库蚊 (*Culex tarsalis*)、果蝇属 (*Drosophila* spp.)、夏厕蝇 (*Fannia canicularis*)、家蝇 (*Musca domestica*)、白蛉属、*Sarcophaga carnaria*、蚋属、厩螫蝇 (*Stomoxys calcitrans*)、欧洲大蚊。

[0119] 鳞翅目,例如小蜡螟 (*Achroia grisella*)、大蜡螟、印度谷螟 (*Plodia interpunctella*)、木塞谷蛾 (*Tinea cloacella*)、袋谷蛾、幕谷蛾。

[0120] 蚤目,例如犬栉首蚤 (*Ctenocephalides canis*)、猫栉首蚤 (*Ctenocephalides felis*)、人蚤 (*Pulex irritans*)、穿皮潜蚤 (*Tunga penetrans*)、印鼠客蚤。

[0121] 膜翅目,例如广布弓背蚁 (*Camponotus herculeanus*)、黑臭蚁 (*Lasius fuliginosus*)、黑蚁 (*Lasius niger*)、*Lasius umbratus*、小家蚁、*Paravespula* spp.、铺道蚁 (*Tetramorium caespitum*)。

[0122] 虱目,例如头虱 (*Pediculus humanus capitis*)、体虱 (*Pediculus humanus corporis*)、癭绵蚜属、*Phylloera vastatrix*、阴虱 (*Phthirus pubis*)。

[0123] 异翅目,例如热带臭虫 (*Cimex hemipterus*)、温带臭虫 (*Cimex lectularius*)、长红猎蝽 (*Rhodinus prolixus*)、侵扰锥猎蝽 (*Triatoma infestans*)。

[0124] 在家用杀虫剂领域,它们可单独使用或者与其它合适的活性化合物结合使用,所述合适的活性化合物例如磷酸酯类、氨基甲酸酯类、拟除虫菊酯类、新烟碱类、生长调节剂或属于其它已知杀虫剂种类的活性化合物。

[0125] 它们可以以下产品的形式使用:气雾剂、无压喷雾 (pressure-free spray) 产品例如泵及雾化器 (atomizer) 喷雾、自动弥雾系统、烟雾剂、泡沫剂、凝胶剂、具有由纤维素或

聚合物制得的蒸发器用片剂 (evaporator tablet) 的蒸发器产品、液体蒸发器、凝胶和薄膜蒸发器、推进剂驱动的蒸发器、无动力 (energy-free) 或无源 (passive) 蒸发系统、捕蛾纸、捕蛾袋和捕蛾胶, 以及作为颗粒剂或粉末剂用于抛撒的饵料中或毒饵站 (bait station) 中。

[0126] 以下实施例说明了本发明活性化合物结合物的良好杀虫活性。虽然单个活性化合物的活性较弱, 但结合物显示出超过了各活性简单加和的活性。

[0127] 当所述活性化合物结合物的活性高于这些活性化合物单独使用时的活性总和时, 总是存在杀虫剂的协同效应。

[0128] 两种活性化合物的给定结合物的预期活性可按照 S. R. Colby, Weeds<sup>15</sup>(1967), 20-22 如下计算:

[0129] 若

[0130] X 为以施用率  $\underline{m}$ g/ha 或浓度  $\underline{m}$ ppm 施用活性化合物 A 时的死亡率, 以未处理对照组的 % 表示,

[0131] Y 为以施用率  $\underline{n}$ g/ha 或浓度  $\underline{n}$ ppm 施用活性化合物 B 时的死亡率, 以未处理对照组的 % 表示, 并且

[0132] E 为以施用率  $\underline{m}$ g/ha 和  $\underline{n}$ g/ha 或者浓度  $\underline{m}$  和  $\underline{n}$  ppm 施用活性化合物 A 和 B 时的死亡率, 以未处理对照组的 % 表示,

[0133] 则

[0134] 
$$E = X + Y - \frac{X \cdot Y}{100} \quad .$$

[0135] 若实际的昆虫死亡率高于计算值, 则结合物的死亡率具有超加和性, 即存在协同效应。此时, 实测的死亡率必定高于用上式计算的预期死亡率值 (E)。

[0136] 实施例 A

[0137] 桃蚜试验

[0138] 溶剂: 7 重量份的二甲基甲酰胺

[0139] 乳化剂: 2 重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

[0140] 为制备合适的活性化合物制剂, 将 1 重量份的活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合, 并将浓液用含有乳化剂的水稀释至所需浓度。

[0141] 将被桃蚜 (*Myzus persicae*) 严重侵染的甘蓝 (*Brassica oleracea*) 叶片通过浸入所需浓度的活性化合物制剂中进行处理。

[0142] 经过所需时间后, 确定以 % 计的死亡率。100% 表示已杀死所有蚜虫; 0% 表示无蚜虫被杀死。将所确定的死亡率代入 Colby 公式 (见表单 1)。

[0143] 本试验中, 例如, 本申请的下列活性化合物结合物较之于单独施用的活性化合物显示出协同增强的活性。

[0144] 表 A

[0145] 损害植物的昆虫

[0146] 桃蚜试验

[0147]

| 活性化合物                           | 浓度<br>以 ppm 计 | 6 天后死亡率<br>以 % 计                                        |
|---------------------------------|---------------|---------------------------------------------------------|
| 化合物 (Ib)                        | 0.8           | 25                                                      |
| 噻虫胺                             | 0.16          | 35                                                      |
| 本发明的<br>化合物 (Ib) + 噻虫胺<br>(5:1) | 0.8+0.16      | <div>实测值*    计算值**</div> <div>75            51.25</div> |

[0148] \* 实测值 = 测得的活性

[0149] \*\* 计算值 = 使用 Colby 公式计算得出的活性

[0150] 实施例 B

[0151] 辣根猿叶甲幼虫试验

[0152] 溶剂： 7 重量份的二甲基甲酰胺

[0153] 乳化剂： 2 重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

[0154] 为制备合适的活性化合物制剂，将 1 重量份的活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合，并将浓液用含有乳化剂的水稀释至所需浓度。

[0155] 将甘蓝 (*Brassica oleracea*) 叶片通过浸入所需浓度的活性化合物制剂中进行处理并在叶子仍湿润时接种辣根猿叶甲 (*Phaedon cochleariae*) 的幼虫。

[0156] 经过所需时间后，确定以 % 计的死亡率。100% 表示已杀死所有甲虫幼虫；0% 表示无甲虫幼虫被杀死。将所确定的死亡率代入 Colby 公式（见表单 1）。

[0157] 本试验中，本申请的下列活性化合物结合物较之于单独施用的活性化合物显示出协同增强的活性。

[0158] 表 B

[0159] 损害植物的昆虫

[0160] 辣根猿叶甲幼虫试验

[0161]

| 活性化合物                           | 浓度<br>以 ppm 计 | 4 天后死亡率<br>以 % 计  |                       |
|---------------------------------|---------------|-------------------|-----------------------|
| 化合物 (Ia)                        | 20            | 5                 |                       |
| 噻虫胺                             | 4             | 25                |                       |
| 本发明的<br>化合物 (Ia) + 噻虫胺<br>(5:1) | 20+4          | <u>实测值*</u><br>55 | <u>计算值**</u><br>28.75 |
| 活性化合物                           | 浓度<br>以 ppm 计 | 6 天后死亡率<br>以 % 计  |                       |
| 化合物 (Ib)                        | 20            | 11                |                       |
| 噻虫胺                             | 4             | 21                |                       |
| 本发明的<br>化合物 (Ib) + 噻虫胺<br>(5:1) | 20+4          | <u>实测值*</u><br>63 | <u>计算值**</u><br>29.69 |

[0162] \* 实测值 = 测得的活性

[0163] \*\* 计算值 = 使用 Colby 公式计算得出的活性