



## (12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 109561676 B

(45) 授权公告日 2022.04.29

(21) 申请号 201780047433.4

R·阿诺德 L·伯德朗 T·维克

(22) 申请日 2017.05.19

(74) 专利代理机构 中国贸促会专利商标事务所  
有限公司 11038

(65) 同一申请的已公布的文献号  
申请公布号 CN 109561676 A

代理人 邹智弘

(43) 申请公布日 2019.04.02

(51) Int.Cl.

(30) 优先权数据

A01N 25/02 (2006.01)

102016210164.1 2016.06.08 DE

A01N 43/36 (2006.01)

(85) PCT国际申请进入国家阶段日  
2019.01.30

(56) 对比文件

(86) PCT国际申请的申请数据

CN 1150888 A, 1997.06.04

PCT/EP2017/062180 2017.05.19

CN 1322472 A, 2001.11.21

(87) PCT国际申请的公布数据

CN 1374834 A, 2002.10.16

W02017/211572 DE 2017.12.14

CN 104365591 A, 2015.02.25

(73) 专利权人 科莱恩国际有限公司  
地址 瑞士穆滕茨

US 5389688 A, 1995.02.14

WO 2010023198 A1, 2010.03.04

EP 2260702 A2, 2010.12.15

US 4595679 A, 1986.06.17

US 4361436 A, 1982.11.30

(72) 发明人 J·阿朋特 P·鲍尔

审查员 文成丹阳

G·史怀尼哲 R·米尔布拉特

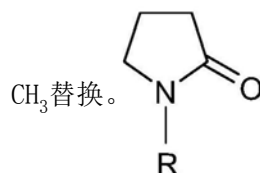
权利要求书2页 说明书55页 附图4页

(54) 发明名称

N-取代的吡咯烷酮用于促进农用化学活性  
成分的渗透的用途

(57) 摘要

描述了一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯  
烷酮用于促进农用化学活性成分渗透至植物中  
或非植物有害生物中的用途,其中,R表示具有3  
至6个碳原子的直链的或支链的、饱和的烷基,其  
中在所述烷基中,氢-H可以被甲氧基-OCH<sub>3</sub>替换,  
和其中吡咯烷酮环的1至6个氢-H可以被甲基-



1.N-(正丁基)-2-吡咯烷酮(NBP)的用途,用于促进一种或更多种农用化学活性成分渗透至植物中或非植物有害生物中,其中

在10℃下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.5重量%,农用化学活性成分为噻草酮,噻草酮的浓度为2.25g/l,促进噻草酮渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在室温下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.1重量%,农用化学活性成分为噻草酮,噻草酮的浓度为2.25g/l,促进噻草酮渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在室温下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.5重量%,农用化学活性成分为噻草酮,噻草酮的浓度为2.25g/l,促进噻草酮渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在10℃下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.5重量%,农用化学活性成分为嘧菌酯和戊唑醇,其中嘧菌酯的浓度为0.45g/l,促进嘧菌酯渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在室温下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.5重量%,农用化学活性成分为嘧菌酯和戊唑醇,其中嘧菌酯的浓度为0.45g/l,促进嘧菌酯渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在10℃下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.5重量%,农用化学活性成分为嘧菌酯和戊唑醇,其中戊唑醇的浓度为0.75g/l,促进戊唑醇渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在10℃下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.3重量%,农用化学活性成分为氟唑菌酰胺和吡唑醚菌酯,其中吡唑醚菌酯的浓度为0.566g/l,促进吡唑醚菌酯渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在室温下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.3重量%,农用化学活性成分为氟唑菌酰胺和吡唑醚菌酯,其中吡唑醚菌酯的浓度为0.566g/l,促进吡唑醚菌酯渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在10℃下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.1重量%,农用化学活性成分为噻虫啉,其中噻虫啉的浓度为0.3g/l,促进噻虫啉渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在10℃下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.3重量%,农用化学活性成分为噻虫啉,其中噻虫啉的浓度为0.3g/l,促进噻虫啉渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在10℃下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.5重量%,农用化学活性成分为噻虫啉,其中噻虫啉的浓度为0.3g/l,促进噻虫啉渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在室温下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.1重量%,农用化学活性成分为噻虫啉,其中噻虫啉的浓度为0.3g/l,促进噻虫啉渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在室温下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.3重量%,农用化学活性成分为噻虫啉,其中噻虫啉的浓度为0.3g/l,促进噻虫啉渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在室温下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.5重量%,农用化学活性成分为噻虫啉,其中噻虫啉的浓度为0.3g/l,促进噻虫啉渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在10℃下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.1重量%,农用化学活性成分为啶虫脒,其中啶虫脒的浓度为0.3g/l,促进啶虫脒渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在10℃下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.3重量%,农用化学活性成分为啶虫脒,其中啶虫脒的浓度为0.3g/l,促进啶虫脒渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在10℃下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.5重量%,农用化学活性成分为啶虫脒,其中啶虫脒的浓度为0.3g/l,促进啶虫脒渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在10℃下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.3重量%,农用化学活性成分为氟乐灵,其

中氟乐灵的浓度为3.5g/1,促进氟乐灵渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在10℃下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.5重量%,农用化学活性成分为氟乐灵,其中氟乐灵的浓度为3.5g/1,促进氟乐灵渗透至植物中或非植物有害生物中;或

在10℃下,在含水喷雾液中,NBP的浓度为0.5重量%,农用化学活性成分为氯虫苯甲酰胺,其中氯虫苯甲酰胺的浓度为0.1g/1,促进氯虫苯甲酰胺渗透至植物中或非植物有害生物中。

## N-取代的吡咯烷酮用于促进农用化学活性成分的渗透的用途

### 技术领域

[0001] 本发明涉及特定的N-取代的吡咯烷酮用于促进农用化学活性成分在植物中或在非植物有害生物中的渗透的用途,或者用于促进农用化学活性成分在植物中或在非植物有害生物中的渗透的相应方法,以及含有特定的N-取代的吡咯烷酮的植物保护剂。

### 背景技术

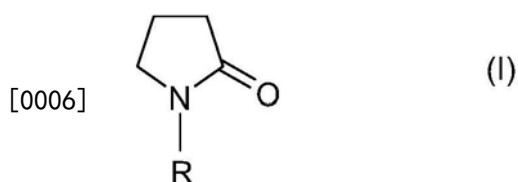
[0002] 在施用农用化学活性成分时的一般问题在于,仅活性成分的一小部分发挥期望的活性。更大部分经常未经利用就损失,这是由于活性成分在洒布例如喷雾液时并未到达植物的叶或根,而是未经利用就渗进土壤中,没有良好地附着在目标植物上,被雨水冲洗掉或简单地并未被植物恰当地吸收。但是另一问题还可能在于,农用化学活性成分没有或没有以足够的量侵入非植物有害生物中并且因此没有发挥其全部效力。

[0003] 为了更好地将农用化学活性成分吸收到植物中,例如促进农用化学活性成分渗透到植物中的物质具有重要作用。典型的代表是提高通过叶面的渗透速率的酯化的植物油,或提高接触面积的表面活性剂和矿物油。但是具有这些作用机理的试剂通常由于如不足的植物相容性,在使用时的问题或者在制剂或应用液体中的稳定性,不足的效果,过高的消耗量或成本而是需要改进的。此外还期望的提供促进农用化学活性成分渗透至非植物有害生物中的物质。

### 发明内容

[0004] 因此提出的任务在于,提供以有利的方式适合于促进农用化学活性成分渗透至植物中或非植物有害生物中的物质。

[0005] 现已出人意料地发现,该目的得以解决并且式(I)的N-取代的吡咯烷酮以有利的方式适合于促进一种或更多种农用化学活性成分渗透至植物中或非植物有害生物中

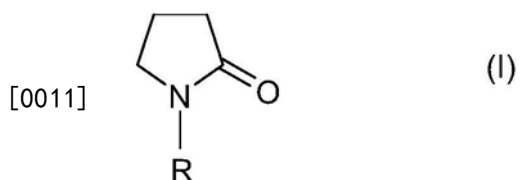


[0007] 其中

[0008] R表示具有3至6个,优选3至5个并且特别优选4个碳原子的直链的或支链的、饱和的烷基,其中在所述烷基中,氢-H可以被甲氧基-OCH<sub>3</sub>替换,

[0009] 和,其中吡咯烷酮环的1至6个氢-H可以被甲基-CH<sub>3</sub>替换。

[0010] 本发明的主题因此是一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮的用途,用于促进一种或更多种农用化学活性成分渗透至植物中或非植物有害生物中,



[0012] 其中

[0013] R表示具有3至6个,优选3至5个并且特别优选4个碳原子的直链的或支链的、饱和的烷基,其中在所述烷基中,氢-H可以被甲氧基-OCH<sub>3</sub>替换,

[0014] 和,其中吡咯烷酮环的1至6个氢-H可以被甲基-CH<sub>3</sub>替换。

[0015] 所述一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮相应地为N-取代的2-吡咯烷酮,即,吡咯烷酮环的羰基CO与环氮N相邻。

[0016] 通过式(I)的N-取代的吡咯烷酮作为渗透促进剂的作用,农用化学活性成分的生物学效果由于其在植物中,例如在角质层中,或在非植物有害生物中的增强的侵入而得以提高。尤其是在一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮存在下,与使用不存在式(I)的N-取代的吡咯烷酮的农用化学活性成分情况相比,在植物中或在非植物有害生物中吸收更多的农用化学活性成分。

[0017] 式(I)的N-取代的吡咯烷酮的特征在于非常有利的毒理学和生态学特征。借助于式(I)的N-取代的吡咯烷酮,可以制备没有生殖风险作用的并且具有高的生物活性的植物保护剂制剂。

[0018] 式(I)的N-取代的吡咯烷酮具有良好的溶解能力性质并且允许具有农用化学活性成分的植物保护剂的高负荷。在此,N-取代的吡咯烷酮尤其可以用做极性非质子溶剂。

[0019] 例如,采用N-(正丁基)-2-吡咯烷酮能够以大于20重量%的量制备嘧菌酯的溶液、以大于50重量%的量制备戊唑醇的溶液、以大于35重量%的量制备丙硫菌唑的溶液、以大于15重量%的量制备吡虫啉的溶液、以大于50重量%的量制备噻草酮的溶液、以大于20重量%的量制备苯嘧磺草胺的溶液和以大于15重量%的量制备噻虫啉的溶液,其中活性成分的给出的量各自基于溶液的总重量计。

[0020] 由于式(I)的N-取代的吡咯烷酮的高的水溶性,其例如可以作为单独的液相用于植物保护剂中,或也例如在水溶性浓缩物(SL)中与水组合。

[0021] 此外,式(I)的N-取代的吡咯烷酮还可以以有利的方式与各种水不可混溶的溶剂组合并且可以作为共溶剂用于含有溶剂的制剂中,例如乳液浓缩物(EC)、油分散体(OD)、悬乳液(SE)和微乳液(ME)中。尤其是,N-(正丁基)-2-吡咯烷酮可与许多溶剂以所有比例混合,例如与水、丙二醇、聚乙二醇、二甲基酰胺、**Solvesso**<sup>®</sup> 200ND、烷基化的植物油或矿物油混合。

[0022] 借助于式(I)的N-取代的吡咯烷酮,可以制备储存稳定的植物保护剂和优选储存稳定的液体植物保护剂。

[0023] 由W02013/107822已知N-取代的吡咯烷酮作为“非生殖毒性”溶剂或没有生殖风险作用的溶剂的用途。在W02013/107822中还描述了所述溶剂可以在农用化学制剂中作为溶解性、稀释性或分散性试剂使用。

[0024] 在W02005/104844中描述了式R<sup>1</sup>-CO-NR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>的羧酸酰胺用于促进农用化学活性成分渗透至植物中的用途,其中R<sup>1</sup>表示C<sub>3</sub>-C<sub>19</sub>-烷基,R<sup>2</sup>表示C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基和R<sup>3</sup>表示H或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基。这

些羧酸酰胺为非环状化合物。

[0025] EP0453915A1公开了N-烷基内酰胺用于在洒布含水喷雾液时防止结晶,尤其是特定的唑衍生物活性成分结晶的用途,所述内酰胺在环的氮N上被具有6至18个碳原子的烷基取代。所述N-烷基内酰胺可以例如为对应的N-烷基吡咯烷酮。

[0026] 在本发明的特别优选的实施方案中,将所述一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮用于促进一种或更多种农用化学活性成分渗透至植物中。

[0027] 在本发明的另一特别优选的实施方案中,将所述一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮用于促进一种或更多种农用化学活性成分渗透至非植物有害生物中。

[0028] 在本发明的另一特别优选的实施方案中,将所述一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮既用于促进一种或更多种农用化学活性成分渗透至植物中,又用于促进一种或更多种农用化学活性成分渗透至非植物有害生物中。这尤其可以出现在这样的情况下:非植物有害生物位于植物上,将所述植物用一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮和一种或更多种农用化学活性成分处理,并且因此也与这些物质接触。一方面促进渗透至植物中并且另一方面渗入非植物有害生物中可以同时发生或时间上相继发生,例如这取决于在植物用一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮和一种或更多种农用化学活性成分处理时,非植物有害生物是否已经位于植物上或者在时间上之后才位于植物上。

[0029] 优选地,所述一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮选自N-(正丁基)-2-吡咯烷酮、N-(异丁基)-2-吡咯烷酮、N-(叔丁基)-2-吡咯烷酮、N-(正戊基)-2-吡咯烷酮、N-(甲基取代的丁基)-2-吡咯烷酮、环-甲基取代的N-(丙基)-2-吡咯烷酮、环-甲基取代的N-(丁基)-2-吡咯烷酮和N-(甲氧基丙基)-2-吡咯烷酮。

[0030] 根据本发明所使用的式(I)的N-取代的吡咯烷酮包括其中吡咯烷酮环的1至6个氢-H可以被甲基-CH<sub>3</sub>替代的化合物。在本申请的范围内,这些化合物也被称为式(I)的“环-甲基取代的N-取代的吡咯烷酮”。环-甲基取代在这种情况下可以存在于吡咯烷酮环的3、4或5位上。环-甲基取代可以为环被甲基取代。但是其例如还包括环二甲基取代,优选在吡咯烷酮环的两个不同位置处,例如在吡咯烷酮环的3位和4位、3位和5位或者4位和5位。环-甲基取代此外包括环三甲基取代,优选在环-甲基取代的式(I)的N-取代的吡咯烷酮的吡咯烷酮环的3、4和5位的三甲基取代。

[0031] 式(I)的环-甲基取代的N-取代的吡咯烷酮优选为不同的式(I)的环-甲基取代的N-(丙基)-2-吡咯烷酮和环-甲基取代的N-(丁基)-2-吡咯烷酮,式(I)的环-甲基取代的N-(正丙基)-、N-(异丙基)-、N-(正丁基)-、N-(异丁基)-、N-(叔丁基)-、N-(仲丁基)-和N-(1-甲基丙基)-2-吡咯烷酮是特别优选的并且尤其优选式(I)的环-甲基取代的N-(正丁基)-2-吡咯烷酮。

[0032] 优选地,在一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮中,没有吡咯烷酮环的氢-H被甲基-CH<sub>3</sub>替换。

[0033] 进一步优选的是,在一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮的残基R的烷基中,没有氢-H被甲氧基-OCH<sub>3</sub>替换。

[0034] 特别优选地,式(I)的N-取代的吡咯烷酮为N-(正丁基)-2-吡咯烷酮。

[0035] 根据本发明单独地或以混合物形式使用式(I)的N-取代的吡咯烷酮。

[0036] 式(I)的N-取代的吡咯烷酮可以是商业上可得的或可根据本领域技术人员熟知的

方法合成。

[0037] 在本发明的优选的实施方案中,一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮在根据本发明的用途的情况下用于植物保护剂中,所述植物保护剂含有

[0038] a) 1至90重量%并且优选5至70重量%的一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮,和

[0039] b) 1至90重量%并且优选2.5至70重量%的一种或更多种农用化学活性成分。

[0040] 上述和在根据本发明的用途的情况下使用的植物保护剂可以包含一种或更多种添加物。它们优选包含0至98重量%并且特别优选1至60重量%的一种或更多种添加物。

[0041] 在本发明的另一优选实施方案中,将一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮在根据本发明的用途的情况下用于植物保护剂中,所述植物保护剂含有

[0042] a) 1至50重量%,优选5至40重量%并且特别优选5至30重量%的一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮,和

[0043] b) 1至90重量%,优选5至60重量%并且特别优选2.5至50重量%的一种或更多种农用化学活性成分。

[0044] 上述和在根据本发明的用途的情况下使用的植物保护剂可以含有一种或更多种添加物。它们优选包含0至98重量%并且特别优选1至50重量%的一种或更多种添加物。

[0045] 在本发明的优选的实施方案中,在根据本发明的用途的情况下使用的植物保护剂未水。

[0046] 一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮在根据本发明的用途的情况下还可以以桶混添加剂使用,即它们不是植物保护剂的一体的成分。更确切地说,一方面尤其存在一种或更多种农用化学活性成分并且另一方面彼此分开地存在式(I)的N-取代的吡咯烷酮。将两种组分在洒布之前,通常短时间之前彼此混合。在洒布之前还可以添加其它组分,例如任选的一种或更多种添加物和/或水。在此,原则上仅在短时间内产生植物保护剂,其含有一种或更多种农用化学活性成分、一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮和任选的一种或更多种添加物和/或水。

[0047] 在本发明的另一优选实施方案中,一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮在根据本发明的用途的情况下用于桶混添加剂中,所述桶混添加剂含有1至90重量%,优选5至50重量%并且特别优选5至20重量%的一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮,和另外的一种或更多种添加物和任选的水。一种或更多种添加物的量在桶混添加剂为优选5至95重量%,特别优选10至90重量%,并且尤其优选20至80重量%。

[0048] 用于根据本发明的用途的各种制剂类型的植物保护剂的各自的表面相关和/或物体相关的施用量非常强烈地变化。通常,为此将本领域技术人员作为常规用于各种使用区域已知的施用介质以常规的量使用,例如从标准喷洒方法的情况下的每公顷五十至几百升水经过在“超低体积”飞机施用的情况下的每公顷几升油直至在注射方法的情况下的几毫升生理溶液。植物保护剂在相应的施用介质中的浓度因此在宽范围内变化并且取决于各种使用领域。通常使用本领域技术人员已知对于各种使用领域常规的浓度。

[0049] 植物保护剂可以例如呈液体制剂常用的配制剂形式,无论是原样还是在预先用水稀释之后,即作为乳液、悬浮液或溶液。在这种情况下,按照常用方法,例如通过喷洒、流延或注射进行施用。

[0050] 植物保护剂的施用量可以在更广泛的范围内变化。它取决于各种农用化学活性成分和取决于其在制剂中的含量。

[0051] 在本发明的另一优选实施方案中,一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮在根据本发明的用途的情况下以含水喷雾液形式的植物保护剂形式使用。这些含水喷雾液优选含有

[0052] a) 0.001至99重量%,特别优选0.01至50重量%,并且尤其优选0.02至1重量%的一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮,和

[0053] b) 0.001至10重量%,特别优选0.002至5重量%,并且尤其优选0.0025至3重量%的一种或更多种农用化学活性成分。

[0054] 上述和在根据本发明的用途的情况下使用的含水喷雾液可以含有一种或更多种添加物。它们含有优选0至99重量%并且特别优选0.01至80重量%的一种或更多种添加物。

[0055] 涉及式(I)的N-取代的吡咯烷酮、农用化学活性成分和添加物的量的值基于在根据本发明的用途的情况下使用的植物保护剂的总重量计,并且在农用化学活性成分为质子化形式的酸但是以其水溶性盐形式使用的情况下,基于游离酸的量计,即所谓的酸当量("acid equivalent", a.e.)。

[0056] "农用化学活性成分"在本说明书的范围内理解为其生物学效力可以由于增强地侵入种植植物或有害植物中或非植物有害生物中而得以提高的所有活性成分。

[0057] 优选的农用化学活性成分选自农药。农药(其中除草剂占最大份额)是合成制备的或天然来源的化学物质,其侵入植物细胞、植物组织中或植物中或植物上的寄生生物或者非植物有害生物中,并且将其损坏和/或破坏。优选的农药选自杀真菌剂、杀菌剂、杀昆虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、除草剂、植物生长调节剂、植物营养物、驱避剂、杀软体动物剂和灭鼠剂。特别优选的农药选自除草剂、杀真菌剂和杀昆虫剂。

[0058] 作为除草剂的实例,提及:

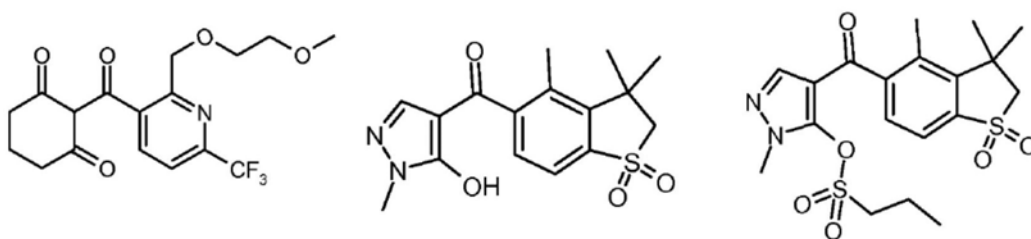
[0059] 基于抑制例如乙酰乳酸合成酶、乙酰辅酶A羧化酶、纤维素合成酶、烯醇丙酮莽草酸-3-磷酸合成酶,谷氨酰胺合成酶,对羟基苯丙酮酸双加氧酶,八氢番茄红素脱氢酶,光系统I,光系统II,原卟啉原氧化酶的活性成分,如例如由Weed Research 26(1986) 441 445或"The Pesticide Manual",第16版,英国作物保护委员会和皇家化学会,2012以及其中引用的文献所描述。作为已知的除草剂或植物生长调节剂,提及例如以下活性成分(用根据国际标准化组织的"通用名"或用化学名称或用代码号命名化合物)并且始终包括所有应用形式,如酸、盐、酯和异构体,如立体异构体和光学异构体。在这种情况下例如为并且有时也提及多种应用形式:

[0060] 乙草胺、噻二唑素、活化酯、氟锁草醚、三氟羧草醚、苯草醚、甲草胺、草毒死、枯杀达、枯杀达钠、莠灭净、氨唑草酮、先甲草胺、磺氨磺隆、环丙嘧啶醇、环丙嘧啶酸钾、环丙嘧啶酸甲酯、氯氨吡啶酸、杀草强、氨基磺酸铵、嘧啶醇、莎稗磷、磺草灵、莠去津、艾维激素、唑啶草酮、四唑嘧磺隆、叠氮津、氟丁酰草胺、草除灵、乙基草除灵、苯唑磺隆、氟草胺、呋草黄、地散磷、苄嘧磺隆、甲基苄嘧磺隆、灭草松、双苄嘧草酮、苯并双环酮、吡草酮、氟磺胺草、新燕灵、苄基腺嘌呤、氟吡草酮、甲羧除草醚、双丙氨酰膦、双丙氨酰膦钠、双嘧草醚、双草醚、除草定、溴丁酰草胺、杀草全、溴苯腈、溴谷隆、特克草、羟草酮、丁草胺、氟丙嘧草酯、草胺磷、丁烯草胺、地乐胺、丁氧环酮、丁草敌、唑草胺、甲萘威、长杀草、氟酮唑草、乙基氟酮唑

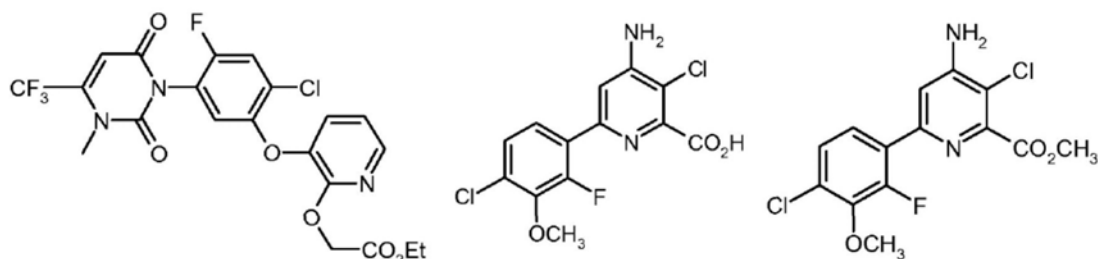


草、香芹酮、氯化氯胆碱、氯硝醚、草灭畏、炔禾灵、丁基炔禾灵、氯溴隆、氯草灵、伐草克、伐草克钠、燕麦酯、氯甲丹、甲基氯甲丹、杀草敏、氯嘧磺隆、乙基氯嘧磺隆、矮壮素、草枯醚、4-氯苯氧基乙酸、Chlorophthalim、氯苯胺灵、敌草索、绿麦隆、绿磺隆、吡啶酮草酯、乙基吡啶酮草酯、环庚草醚、醚磺隆、烯草酮、炔草酯、炔丙基炔草酯、苯吡酮酸、异恶草酮、稗草胺、调果酸、二氯吡啶酸、唑嘧磺胺盐、甲基唑嘧磺胺盐、座果酸、苄草隆、氨基氰、草净津、环丙酰胺、草灭特、环丙磺隆、噻草酮、环莠隆、氰氟草酯、丁基氰氟草酯、莎草快、环草津、环唑草胺、细胞分裂素、2,4-D、2,4-DB、杀草隆/香草隆、茅草枯、丁酰肼、棉隆、正癸醇、异苯敌草、敌草净、Detosyl-pyrazolate (DTP)、燕麦敌、Diaminozid、麦草畏、敌草腈、高2,4-滴丙酸、氯甲草、禾草灵、高禾草灵、精高禾草灵、唑嘧磺胺、安塔、乙基安塔、枯莠隆、野燕枯、吡氟草胺、二氟吡隆、二氟吡隆钠、敌草克钠、丁噁隆、哌草丹、克草胺、戊草津、噻吩草胺、精噻吩草胺、噻节因、Dimetrasulfuron、敌乐胺、地乐酚、地乐消酚、草乃敌、二异丙基萘、杀草净、敌草快、敌草快二溴化物、氟硫草定、敌草隆、DNOC、草止津、内氧草索、EPTC、禾草畏、丁氟消草、胺苯磺隆、甲基胺苯磺隆、萘乙酸乙酯、乙烯利、噻二唑隆、乙噻草酮、乙呋草黄、氯氟草醚、乙基氯氟草醚、乙氧嘧磺隆、乙苯酰草、F-5331,即N-[2-氯-4-氟-5-[4-(3-氟丙基)-4,5-二氢-5-氧代-1H-四唑-1-基]苯基]乙磺酰胺、F-7967,即3-[7-氯-5-氟-2-(三氟甲基)-1H-苯并咪唑-4-基]-1-甲基-6-(三氟甲基)嘧啶-2,4(1H,3H)-二酮、2,4,5-涕丙酸、噁唑禾草灵、高噁唑禾草灵丙酯、噁唑禾草灵乙酯、高噁唑禾草灵乙酯、芬诺杀磺隆、四唑草胺、非草隆、氟燕灵、强氟燕灵异丙酯、麦草伏M、啶嘧磺隆、氟吡醚、吡氟禾草灵、精吡氟禾草灵、丁基吡氟禾草灵、精丁基吡氟禾草灵、异丙吡草酯、氟唑磺隆、氟唑磺隆钠、氟吡磺隆、氟消草、氟噻草胺(Thiafluamide)、氟吡啶草酯、氟吡啶草乙酯、氟节胺、氟吡啶草、氟烯草酸、氟烯草酸戊酯、氟噁嗪酮、炔草胺、伏草隆、消草醚、羧氟草醚、乙羧氟草醚、胺草唑、Flupropacil、四氟丙酸、氟啶磺隆、甲基氟丙磺隆钠、抑草丁、丁基抑草丁、氟草同、氟咯草酮、氯氟吡氧乙酸、氯氟吡氧乙酸异辛酯、调嘧醇、呋草酮、达草氟、甲基达草氟、噻唑草酰胺、氟磺胺草醚、甲酰胺磺隆、氯吡脞、蔓草磷、氟呋草醚、赤霉酸、草胺膦(Glufosinate)、草胺膦、草胺膦-P、草胺膦-P-钠、草甘膦、草甘膦异丙铵盐、H-9201,即O-(2,4-二甲基-6-硝基苯基)-O-乙基异丙基硫代磷酰胺、氟硝磺酰胺、吡氯磺隆、吡氯磺隆甲酯、吡氟氯禾灵、精吡氟氯禾灵、乙氧基乙基吡氟氯禾灵、精乙氧基乙基吡氟氯禾灵、甲基吡氟氯禾灵、精甲基吡氟氯禾灵、六嗪同、HW-02,即1-(二甲氧基磷酰基)-乙基-(2,4-二氯苯氧基)乙酸酯、咪草酸、咪草酯、甲氧咪草烟、甲氧咪草烟铵盐、甲咪唑烟酸、咪唑烟酸、咪唑烟酸异丙铵盐、咪唑喹啉酸、咪唑喹啉酸铵盐、咪唑乙烟酸、咪唑乙烟酸铵盐、唑吡嘧磺隆、抗倒胺、茚草酮、三嗪茚草胺、吡啶乙酸(IAA)、4-吡啶-3-基丁酸(IBA)、碘磺隆、甲基碘磺隆钠、Iofensulfuron、Iofensulfuron钠盐、碘苯腈、Ipfencarbazone、丁环隆、异乐灵、异丙隆、异恶隆、异恶草胺、氯草酮、异噁氟草、恶草醚、KUH-043,即3-([5-(二氟甲基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-基]甲基)磺酰基)-5,5-二甲基-4,5-二氢-1,2-噁唑、卡草灵、Ketospiradox、乳氟禾草灵、环草定、利谷隆、抑芽丹、MCPA、MCPB、2-甲-4-氯丁酸甲酯、2-甲-4-氯丁酸乙酯、2-甲-4-氯丁酸钠、2-甲-4-氯丙酸、2-甲-4-氯丙酸钠、2-甲-4-氯丙酸丁氧基乙酯、高2-甲-4-氯丙酸丁氧基乙酯、高2-甲-4-氯丙酸二甲胺、高2-甲-4-氯丙酸乙基己酯、高2-甲-4-氯丙酸钾、苯噻草胺、氟草磺、氯化助壮素、甲基二磺隆、甲基二磺隆-甲基、甲基磺草酮、甲基苯噻隆、安百亩、噁唑酰草胺、苯噻草酮、吡草胺、Metazasulfuron、灭草

定、Methiopyrsulfuron、Methiozolin、去草酮、甲基杀草隆、1-甲基环丙烯、异硫氰酸甲酯、色满隆、秀谷隆、异丙甲草胺、精异丙甲草胺、唑草磺胺、甲氧隆、噻草酮、甲磺隆、甲基甲磺隆、草达灭、杀草利、单脲、硫酸二氢单脲、绿谷隆、单嘧磺隆、单嘧磺隆酯、灭草隆、MT-128, 即6-氯-N-[ (2E)-3-氯丙-2-烯-1-基]-5-甲基-N-苯基哒嗪-3-胺、MT-5950, 即N-[3-氯-4-(1-甲基乙基) 苯基]-2-甲基戊酰胺、NGGC-011、1-萘乙酸(NAA)、萘乙酰胺(NAAm)、2-萘氧基乙酸、萘丙胺、草萘胺、抑草生、NC-310, 即4-(2,4-二氯苯甲酰基)-1-甲基-5-苄基氧基吡唑、草不隆、烟嘧磺隆、吡氯草胺、磺乐灵、除草醚、硝基愈创木酚盐、硝基愈创木酚钠(异构体混合物)、硝氟草醚、壬酸、达草灭、坪草丹、Orthosulfamuron、黄草消、炔丙噁唑草、恶草灵、环丙氧黄隆、氯噁唑草、氟硝草醚、多效唑、对草快、对草快二氯化物、风吕草酸(壬酸)、二甲戊灵、Pendralin、五氟磺草胺、甲氯酰草胺、环戊噁草酮、黄草伏、烯草胺、棉胺宁、甜菜宁、甜菜宁乙酯、氨基吡啶酸、氟吡酰草胺、唑啉草酯、嘧草磷、Pirifenop、Pirifenopbutyl、丙草胺、氟嘧磺隆、氟嘧磺隆甲酯、噻菌灵、氟唑草胺、环氰津、氨基丙氟灵、Prifluraline、环苯草酮、调环酸、调环酸钙、茉莉酮、扑灭通、扑草净、扑草胺、敌稗、啶草酸、扑灭津、苯胺灵、异丙草胺、丙苯磺隆、丙苯磺隆钠、丙噻嘧磺隆、拿草特、磺亚胺草、苄草丹、氟丙磺隆、广草胺、双唑草腈、氟唑草酯、氟唑草乙酯、Pyrasulfotole、吡唑特(Pyrazolate)、吡嘧磺隆、吡嘧磺隆乙酯、苄草唑、丙酯草醚、异丙基丙酯草醚、丙基丙酯草醚、噻苯草肟、稗草畏、氯苯哒醇、达草止、环酯草醚、肟啶草、肟啶草甲酯、Pyrimisulfan、嘧硫苯甲酸、嘧硫苯甲酸钠、Pyroxasulfone、吡唑磺草胺、二氯喹啉酸、喹草酸、灭藻醌、喹禾灵、喹禾灵乙酯、精喹禾灵、精喹禾灵乙酯、精喹禾灵四氢糠基酯、玉嘧磺隆、苯嘧磺草胺、密草通、稀禾定、环草隆、西玛津、西草净、SN-106279, 即(2R)-2-({7-[2-氯-4-(三氟甲基) 苯氧基]-2-萘基} 氧基) 丙酸甲酯、磺草酮、草克死(CDEC)、磺胺草唑、嘧磺隆、嘧磺隆甲酯、草硫膦(草甘膦三甲基铊盐)、磺酰磺隆、SW-065、SYN-523、SYP-249, 即1-乙氧基-3-甲基-1-氧代丁-3-烯-2-基-5-[2-氯-4-(三氟甲基) 苯氧基]-2-硝基苯甲酯、SYP-300, 即1-[7-氟-3-氧代-4-(丙-2-炔-1-基)-3,4-二氢-2H-1,4-苯并噁嗪-6-基]-3-丙基-2-硫代咪唑烷-4,5-二酮、丙戊草胺、丁唑隆、四氯硝基苯、特呋三酮、环磺酮、酞肟草、特草定、芽根灵、猛杀草、甲氧去草净、特丁津、去草净、噻醚草胺、Thiafluamide、赛唑隆、噻苯隆、噻二唑胺、赛二唑素、噻酮磺隆、噻酮磺隆甲酯、噻磺隆、噻磺隆甲酯、杀草丹、丁草威、吡草磺、肟草酮、特糠酯酮、野麦畏、醚苯磺隆、苯氧丙胺津、Triazofenamide、苯磺隆、苯磺隆甲酯、脱叶磷、三氯乙酸(TCA)、三氯吡氧乙酸、灭草环、草达津、三氟啶磺隆、三氟啶磺隆钠、氟乐灵、氟胺磺隆、氟胺磺隆甲酯、三甲隆、抗倒酸、抗倒酯、三氟甲磺隆、Tsitodef、烯效唑、高烯效唑、灭草猛、ZJ-0862, 即3,4-二氯-N-{2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基) 氧基] 苄基} 苯胺, 以及以下化合物:



[0061]



[0062] 作为植物生长调节剂的实例,另外提及:S-诱抗素、先甲草胺(Amidochlor)、环丙嘧啶醇、6-苄基氨基嘌呤、芸薹素内酯、油菜素甾醇、仲丁灵、Chlormequat(矮壮素)、氯化胆碱、环丙酰胺酸、丁酰肼、调温酸、噻节因、2,6-二甲基吡啶、乙烯利、氟节胺、呋啶醇、噻草酸、氯吡脒、赤霉酸、抗倒胺、吲哚-3-乙酸、茉莉酸、糠氨基嘌呤、抑芽丹、氟磺酰草胺、Mepiquat(甲哌鎗)、1-萘乙酸、N-6-苄基腺嘌呤、多效唑、调环酸(调环酸钙)、茉莉酮、水杨酸及其酯、噻苯隆、抑芽唑、脱叶磷、2,3,5-三碘苯甲酸、抗倒酯和烯效唑。

[0063] 进一步提及作为植物生长调节剂和/或植物强化剂起作用,从而使降低应激因子如热、冷、干旱、盐、氧气缺乏或涝对植物生长的影响的物质。在此例如提及甘氨酸甜菜碱(甜菜碱)、胆碱、磷酸钾或另外的磷酸盐,以及硅酸盐。

[0064] 作为植物营养物的实例,提及通常用于为植物供给大量营养物和/或微量营养物的无机或有机的肥料。

[0065] 作为杀真菌剂的实例,提及:

[0066] (1) 麦角固醇生物合成抑制剂,例如4-十二烷基-2,6-二甲基吗啉、戊环菌、联苯三唑醇、糠菌唑、环菌唑、苄氯三唑醇、噁醚唑、烯唑醇、精烯唑醇、吗菌灵、吗菌灵乙酸酯、氧唑菌、乙环唑、异噁菌醇、腈苯唑、环酰菌胺、苯锈啉、丁苯吗啉、啉唑菌酮、调啉醇、氟硅唑、粉唑醇、呋菌唑、呋醚唑、己唑醇、烯菌灵、烯菌灵硫酸盐、酰胺唑、环戊唑醇、叶菌唑、腈菌唑、萘替芬、氟苯嘧啶醇、噁咪唑、多效唑、稻瘟酯、戊菌唑、粉病灵、咪鲜胺、丙环唑、丙硫菌唑、稗草畏、啉斑肟、啉唑菌酮、硅氟唑、螺环菌胺、戊唑醇、特比萘芬、四氟醚唑、三唑酮、啉菌醇、克啉菌、氟菌唑、噻菌灵、戊叉唑菌、烯效唑、高烯效唑、烯霜苄唑、伏立康唑、1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)环庚醇、1-(2,2-二甲基-2,3-二氢-1H-茚-1-基)-1H-咪唑-5-甲酸甲酯、N'-{5-(二氟甲基)-2-甲基-4-[3-(三甲基甲硅烷基)丙氧基]苯基}-N-乙基-N-甲基亚氨代甲酰胺、N-乙基-N-甲基-N'-{2-甲基-5-(三氟甲基)-4-[3-(三甲基甲硅烷基)丙氧基]苯基}亚氨代甲酰胺和O-[1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁烷-2-基]1H-咪唑-1-硫代甲酸酯。

[0067] (2) 呼吸抑制剂(呼吸链抑制剂),例如联苯吡菌胺、烟酰胺、萎锈灵、氟啉菌胺、呋菌胺、氟吡菌酰胺、氟酰胺、Fenpicoxamid、氟唑菌酰胺、呋吡唑灵、拌种胺、吡唑萘菌胺的合成差向异构外消旋体1RS,4SR,9RS的混合物和吡唑萘菌胺的反差向异构外消旋体1RS,4SR,9SR的混合物、吡唑萘菌胺(反差向异构外消旋体)、吡唑萘菌胺(反差向异构对映异构体1R,

4S,9S)、吡唑萘菌胺(反差向异构对映异构体1S,4R,9R)、吡唑萘菌胺(合成差向异构外消旋体1RS,4SR,9RS)、吡唑萘菌胺(合成差向异构对映异构体1R,4S,9R)、吡唑萘菌胺(合成差向异构对映异构体1S,4R,9S)、丙氧灭锈胺、氧化萎锈灵、氟唑菌苯胺、吡唑菌胺、氟唑环菌胺、溴氟唑菌、1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-甲酰胺,3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、3-(二氟甲基)-N-[4-氟-2-(1,1,2,3,3,3-六氟丙氧基)苯基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、N-[1-(2,4-二氯苯基)-1-甲氧基丙-2-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、5,8-二氟-N-[2-(2-氟-4-{[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]氧基}苯基)乙基]喹唑啉-4-胺、N-[9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-亚甲基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、N-[(1S,4R)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-亚甲基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺和N-[(1R,4S)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-亚甲基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺。

[0068] (3) 作用在呼吸链的配合物III上的呼吸抑制剂(呼吸链抑制剂),例如唑啉菌胺、吡唑磺菌胺、唑啉酯、氟霜唑、甲香菌酯、丁香菌酯、醚菌胺、烯肟菌酯、噁唑酮菌、咪唑菌酮、Fenoxystrobin、氟唑菌酯、亚胺菌、又氨苯酰胺、肟醚菌胺、啉氧菌酯、吡唑醚菌酯、唑胺菌酯、唑菌酯、吡菌苯威、氧啉菌酯、肟菌酯、(2E)-2-(2-{[6-(3-氯-2-甲基苯氧基)-5-氟啉啉-4-基]氧基}苯基)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、(2E)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-2-(2-{[(1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]氨基}氧基]甲基)苯基)乙酰胺、(2E)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-2-{2-[E)-({1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基}亚氨基)甲基]苯基)乙酰胺、(2E)-2-{2-[({(1E)-1-(3-{[E)-1-氟-2-苯基乙烯基]氧基}苯基)亚乙基]氨基}氧基)甲基]苯基}-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、(2E)-2-{2-[({(2E,3E)-4-(2,6-二氯苯基)丁-3-烯-2-亚基]氨基}氧基)甲基]苯基}-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、2-氯-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)吡啶-3-甲酰胺、5-甲氧基-2-甲基-4-(2-{[(1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]氨基}氧基]甲基)苯基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮、(2E)-2-{2-[({环丙基[(4-甲氧基苯基)亚氨基]甲基)硫基]甲基)苯基}-3-甲氧基-丙-2-烯酸甲酯、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-{2-[2,5-二甲基苯氧基]甲基}苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺和(2R)-2-{2-[2,5-二甲基苯氧基]甲基}苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺。

[0069] (4) 有丝分裂和细胞分裂抑制剂,例如苯菌灵、多菌灵、苯咪唑菌、乙霉威、噁唑菌胺、氟吡菌胺、麦穗宁、戊菌隆、涕必灵、甲基托布津、托布津、苯酰菌胺、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]嘧啶和3-氯-5-(6-氯吡啶-3-基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)哒嗪。

[0070] (5) 具有多位点活性的化合物,例如波尔多液(Bordeaux混合剂)、敌菌丹、克菌丹、百菌清、铜制剂如氢氧化铜、环烷酸铜、氧化铜、氧氯化铜、硫酸铜、抑菌灵、二噻农、多果定、多果定游离碱、福美铁、氟灭菌丹、灭菌丹、双胍盐、双胍乙酸盐、辛醋酸盐、辛醋酸苯磺酸盐、双胍辛醋酸三乙酸盐、锰铜混剂、代森锰锌、代森锰、代森联、代森联锌、喹啉铜、二脒二苯氧基丙烷、甲基代森锌、硫和硫制剂,例如多硫化钙、福美双、对甲抑菌灵、代森锌和福美锌。

[0071] (6) 抗性诱导剂,例如噻二唑素、异噻菌胺、噻菌灵和噻酰菌胺。

[0072] (7) 氨基酸和蛋白质生物合成抑制剂,例如胺扑灭、灭瘟素、环丙嘧啶、春雷素、春雷素盐酸盐水合物、噻菌胺、二甲噻菌胺和3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉。

[0073] (8) ATP生产抑制剂,例如毒菌锡醋酸盐、毒菌锡氯、毒菌锡氢氧化物和硅噻菌胺。

[0074] (9) 细胞壁合成抑制剂,例如苯噻菌胺、烯酰吗啉、氟吗啉、异丙菌胺、双炔酰菌胺、多氧霉素、多抗霉素、井冈霉素和缬菌胺。

[0075] (10) 类脂和膜合成抑制剂,例如联苯、地茂散、氯硝胺、稻瘟光、氯唑灵、丁基氨基甲酸碘代丙炔酯、异稻瘟净、稻瘟灵、百维灵、百维灵盐酸盐、胺丙威、定菌磷、五氯硝基苯、四氯硝基苯和甲基立枯磷。

[0076] (11) 黑色素生物合成抑制剂,例如氯环丙酰胺、双氯氰菌胺、氰菌胺、四氯苯酞、咯喹酮、三环唑和{3-甲基-1-[(4-甲基苯甲酰基)氨基]丁-2-基}氨基甲酸2,2,2-三氟乙基酯。

[0077] (12) 核酸合成抑制剂,例如苯霜灵、精苯霜灵(Kiralaxyl)、磺噻菌灵、Clozylacon、甲菌定、乙菌定、呋氨丙灵、土菌消、甲霜灵、精甲霜灵(Mefenoxam)、甲呋酰胺、噁霜灵和噁喹酸。

[0078] (13) 信号传导抑制剂,例如乙菌利、拌种咯、氟噁菌、异丙定、杀菌利、喹氧灵和烯菌酮。

[0079] (14) 去偶剂,例如乐杀螨、二硝巴豆酸酯、噻菌胺、氟啶胺和敌螨普。

[0080] (15) 其它化合物,例如苯噻硫氰、3-苯并[b]噻吩-2-基-5,6-二氢-1,4,2-噁噻嗪4-氧化物、卡巴西霉素、香芹酮、灭螨猛、Pyriofenon(Chlazaferon)、硫杂灵、环氟菌胺、清菌脉、环丙磺酰胺、棉隆、双乙氧咪唑威、双氯酚、哒菌清、野麦枯、野麦枯甲基硫酸酯、二苯胺、Ecomat、胺苯吡菌酮、氟联苯菌、氟氯菌核利、磺菌胺、氟噻菌净、藻菌磷、乙膦酸钙、乙膦酸钠、六氯苯、人间霉素、磺菌威、异硫氰酸甲酯、苯菌酮、米多霉素、多马霉素、二甲二硫代氨基甲酸镍、异丙消、异噻菌酮、Oxamocarb、Oxyfenthiin、五氯苯酚及其盐、苯醚菊酯、磷酸及其盐、百维灵乙膦酸盐、Propanosin-Natrium、丙氧喹啉、丁吡吗啉、(2E)-3-(4-叔丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(吗啉-4-基)丙-2-烯-1-酮、(2Z)-3-(4-叔丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(吗啉-4-基)丙-2-烯-1-酮、硝吡咯菌素、特氟喹啉、叶枯酞、Tolnifanid、唑菌嗪、杨菌胺、氯菌胺、(3S,6S,7R,8R)-8-苄基-3-[(3-[(异丁酰基氧基)甲氧基]-4-甲氧基吡啶-2-基)羰基]氨基]-6-甲基-4,9-二氧代-1,5-二噁烷(dioxonan)-7-基2-甲基丙酸酯、1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁烷-2-基-1H-咪唑-1-甲酸酯、2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺酰基)吡啶、2,3-二丁基-6-氯噻吩并[2,3-d]噻啶-4(3H)-酮、2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二噻噁并(dithiino)[2,3-c:5,6-c']二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮、2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[(5R)-5-苯基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)乙酮、2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[(5S)-5-苯基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-

1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)乙酮、2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-{4-[4-(5-苯基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基)-1,3-噻唑-2-基]哌啶-1-基}乙酮、2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4H-苯并吡喃-4-酮、2-氯-5-[2-氯-1-(2,6-二氟-4-甲氧基苯基)-4-甲基-1H-咪唑-5-基]吡啶、2-苯基苯酚及其盐、3-(4,4,5-三氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉、3,4,5-三氯吡啶-2,6-二甲腈、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基-1,2-噁唑烷-3-基]吡啶、3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基哒嗪、4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基哒嗪、5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇、5-氯-N'-苯基-N'-(丙-2-炔-1-基)噻吩-2-磺酰肼、5-氟-2-[(4-氟苄基)氧基]嘧啶-4-胺、5-氟-2-[(4-甲基苄基)氧基]嘧啶-4-胺、5-甲基-6-辛基-[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-7-胺、(2Z)-3-氨基-2-氰基-3-苯基丙-2-烯酸乙酯、N'-(4-{[3-(4-氯苄基)-1,2,4-噻二唑-5-基]氧基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、N-(4-氯苄基)-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]丙酰胺、N-[(4-氯苯基)(氰基)甲基]-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]丙酰胺、N-[(5-溴-3-氯吡啶-2-基)甲基]-2,4-二氯吡啶-3-甲酰胺、N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯吡啶-3-甲酰胺、N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2-氟-4-碘吡啶-3-甲酰胺、N-{(E)-[(环丙基甲氧基)-亚氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苯基乙酰胺、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-苯基乙酰胺、N'-{4-[3-(叔丁基-4-氰基-1,2-噻唑-5-基)氧基]-2-氯-5-甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-(1,2,3,4-四氢萘-1-基)-1,3-噻唑-4-甲酰胺、N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-[(1R)-1,2,3,4-四氢萘-1-基]-1,3-噻唑-4-甲酰胺、N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-[(1S)-1,2,3,4-四氢萘-1-基]-1,3-噻唑-4-甲酰胺、{6-[(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基}氧基]甲基]吡啶-2-基}氨基甲酸苯酯、吩嗪-1-甲酸、喹啉-8-醇、喹啉-8-醇硫酸酯(2:1)和{6-[(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]-氨基}氧基]甲基]吡啶-2-基}氨基甲酸叔丁酯。

[0081] (16) 其它化合物,例如1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[2'-(三氟甲基)联苯-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、N-(4'-氯联苯-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、N-(2',4'-二氯联苯-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(三氟甲基)-联苯-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、N-(2',5'-二氟联苯-2-基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、5-氟-1,3-二甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、2-氯-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)联苯-2-基]吡啶-3-甲酰胺、3-(二氟甲基)-N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、3-(二氟甲基)-N-(4'-乙炔基联苯-2-基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、N-(4'-乙炔基联苯-2-基)-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、2-氯-N-(4'-乙炔基联苯-2-基)吡啶-3-甲酰胺、2-氯-N-[4'-(3,3-二甲基-丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]吡啶-3-甲酰胺、4-(二氟甲基)-2-甲基-N-[4'-(三氟甲基)联苯-2-基]-1,3-噻唑-5-甲酰胺、5-氟-N-[4'-(3-羟基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、2-氯-N-[4'-(3-羟基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-

基]吡啶-3-甲酰胺、3-(二氟甲基)-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、5-氟-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1,3-二甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、2-氯-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]吡啶-3-甲酰胺、(5-溴-2-甲氧基-4-甲基吡啶-3-基)-(2,3,4-三甲氧基-6-甲基苯基)甲酮、N-[2-(4-{[3-(4-氯苯基)丙-2-炔-1-基]氧基}-3-甲氧基苯基)乙基]-N2-(甲基磺酰基)缬氨酰胺、4-氧代-4-[(2-苯基乙基)氨基]丁酸和{6-[(Z)-(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基}氧基)甲基]吡啶-2-基}氨基甲酸丁-3-炔-1-基酯。

[0082] 所有提及的杀真菌剂(1)至(16)可以在它们由于它们的官能团能够的时候,任选与合适的碱或酸形成盐。

[0083] 作为杀菌剂的实例,提及:

[0084] 溴硝丙二醇、双氯酚、氯定、二甲基二硫代氨基甲酸镍、春雷素、异噻菌酮、呋喃甲酸、土霉素、噻菌灵、链霉素、叶枯酞、硫酸铜以及其它铜配制剂。

[0085] 作为杀昆虫剂、杀螨剂和杀线虫剂的实例,提及:

[0086] (1)乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂,例如氨基甲酸酯类,如棉铃威、涕灭威、噁虫威、丙硫克百威、丁叉威、氧丁叉威、甲萘威、虫螨威、丁硫克百威、苯虫威、丁苯威、伐虫脒、呋线威、异丙威、灭虫威、灭多虫、速灭威、甲氧叉威、抗蚜威、残杀威、硫双威、特氨叉威、唑蚜威、混杀威、二甲威(XMC)和灭杀威;或有机磷类,例如高灭磷、唑啉磷、乙基谷硫磷、甲基谷硫磷、硫线磷、壤虫氯磷、毒虫畏、氯甲磷、毒死蜱、甲基毒死蜱、蝇毒磷、杀螟腈、甲基-O五九、二嗪农、敌敌畏、百治磷、乐果、甲基毒虫畏、乙拌磷、苯硫磷(EPN)、乙硫磷、灭克磷、氨磺磷、克线磷、杀螟松、倍硫磷、噻唑酮磷、庚虫磷、Imicyafos、丙胺磷、O-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸异丙酯、异噁唑磷、马拉硫磷、灭蚜磷、杀扑磷、速灭磷、二溴磷、氧化乐果、砒吸磷、一六零五、甲基一六零五、稻丰散、甲拌磷、伏杀磷、亚胺硫磷、辛硫磷、虫螨磷、丙溴磷、烯虫磷、丙硫磷、吡啶硫磷、打杀磷、喹恶磷、硫特普、噻丙磷、硫甲双磷、特丁磷、杀虫畏、甲基乙拌磷、三唑磷、敌百虫和蚜灭多。

[0087] (2)GABA门控氯离子通道拮抗剂,例如:环二烯有机氯,如氯丹和硫丹;或苯基吡啶类,例如乙虫清和锐劲特。

[0088] (3)钠通道调节剂/电压门控钠通道阻断剂,例如拟除虫菊酯类,如氟丙菊酯、丙烯除虫菊、右旋顺-反丙烯菊酯、右旋反式丙烯菊酯、氟氯菊酯、反丙烯除虫菊、反丙烯除虫菊S-环戊烯基酯异构体、右旋反灭虫菊酯、乙氰菊酯、氟氯氰菊酯、β-氟氯氰菊酯、(RS)氯氟氰菊酯、氯氟氰菊酯、γ-氯氟氰菊酯、氯氰菊酯、甲体氯氰菊酯、乙体氯氰菊酯、高效反式氯氰菊酯、己体氯氰菊酯、苯醚氰菊酯[(1R)-反式异构体]、溴氰菊酯、烯炔菊酯[(EZ)-(1R)异构体]、高氰戊菊酯、醚菊酯、甲氰菊酯、杀灭菊酯、氟氰戊菊酯、氟氰戊菊酯、氟胺氰菊酯、卤醚菊酯、咪炔菊酯、Kadethrin、氯菊酯、苯醚菊酯[(1R)-反式异构体]、炔酮菊酯、除虫菊酯(除虫菊(pyrethrum))、灭虫菊、灭虫硅醚、七氟菊酯、胺菊酯、胺菊酯[(1R)异构体]、四溴菊酯和四氟菊酯;或甲氧滴滴涕。

[0089] (4)烟碱能乙酰胆碱受体(nAChR)激动剂,例如新烟碱类,如啉虫脒、噻虫胺、呋虫胺、吡虫啉、硝胺烯啶、噻虫啉和噻虫嗪;或烟碱。

[0090] (5)烟碱能乙酰胆碱受体(nAChR)变构激动剂,例如多杀菌素类,如乙基多杀菌素或艾克敌105。

- [0091] (6) 氯离子通道激动剂,例如阿维菌素类/米尔倍霉素类,如阿维菌素、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐、Lepimectin或米尔螨素。
- [0092] (7) 保幼激素模拟物,例如保幼激素类似物,如蒙五二、蒙七七和蒙五一五;或双氧威;或蚊蝇醚。
- [0093] (8) 未知或非特异性作用机理的活性成分,例如烷基卤,如溴甲烷和其它的烷基卤;或氯化苦;或二氟二氧化硫;或硼砂;或吐酒石。
- [0094] (9) 选择性拒食剂,例如吡蚜酮;或氟啶虫酰胺。
- [0095] (10) 螨虫生长抑制剂,例如四螨嗪、噻螨酮和Diflovidazin;或特苯噁唑。
- [0096] (11) 昆虫中肠膜的微生物干扰物,例如苏云金杆菌以色列亚种(*Bacillus thuringiensis* Subspecies *israelensis*)、球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus*)、苏云金芽孢杆菌鲎泽亚种(*Bacillus thuringiensis* Subspecies *aizawai*)、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(*Bacillus thuringiensis* Subspecies *kurstaki*)、苏云金芽孢杆菌粉虫亚种(*Bacillus thuringiensis* Subspecies *tenebrionis*)和BT植物蛋白:Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb和Cry34/35Ab1。
- [0097] (12) 氧化磷酸化抑制剂,ATP干扰剂,例如杀螨硫隆;或有机锡化合物,例如唑环锡、三环锡和杀螨锡;或克螨特;或三氯杀螨砜。
- [0098] (13) 中断H<sup>+</sup>质子梯度的氧化磷酸化去偶剂,例如氟唑虫清、DNOC或氟虫胺。
- [0099] (14) 烟碱能乙酰胆碱受体拮抗剂,例如杀虫磺、巴丹、硫环杀和杀虫单。
- [0100] (15) O型几丁质生物合成抑制剂,例如双三氟虫脒、定虫隆、除虫脒、氟螨脒、氟虫脒、氟铃脒、氟丙氧脒、双苯氟脒、多氟脒、伏虫隆和杀虫隆。
- [0101] (16) I型几丁质生物合成抑制剂,例如噻嗪酮。
- [0102] (17) 双翅目(Dipteran)蜕皮干扰剂,例如灭蝇胺。
- [0103] (18) 蜕皮激素受体激动剂,例如Chromafenozide、特丁苯酰肼、甲氧苯酰肼和双苯酰肼。
- [0104] (19) 章鱼胺能激动剂,包括虫螨脒。
- [0105] (20) 复合体III电子传输抑制剂,例如灭蚁腓;或灭螨醌;或噁螨酯。
- [0106] (21) 复合体I电子传输抑制剂,例如METI杀螨剂,如噻螨醚、唑螨酯、噁胺苯醚、哒螨酮、吡螨胺和唑虫酰胺;或鱼藤酮(Derris)。
- [0107] (22) 电压门控钠通道阻断剂,例如噁二唑虫;或氰氟虫腓。
- [0108] (23) 乙酰CoA羧化酶抑制剂,例如特窗酸和特拉姆酸衍生物,如螺螨酯、螺甲螨酯和螺虫乙酯。
- [0109] (24) 复合体IV电子传输抑制剂,例如膦,如磷化铝、二磷化三钙、膦和磷化锌;或氰化物。
- [0110] (25) 复合体II电子传输抑制剂,如腈吡螨酯。
- [0111] (26) 鱼尼汀受体效应物,例如二酰胺类,如氯虫酰胺和氟虫酰胺。
- [0112] 具有未知作用机理的其它活性成分,例如磺胺螨酯、艾扎丁、Benclothiaz、苯螨特、联苯肼酯、溴螨酯、灭螨猛、冰晶石、溴腈虫酰胺(Cyazypyr)、丁氟螨酯、开乐散、氟螨嗪、氟虱灵、噁虫胺、丁烯氟虫腓、氟吡菌酰胺、呋喃虫酰肼、氯噻啉、异丙定、啉虫丙醚、



Pyrifluquinazon和碘甲烷;和额外的基于坚强芽孢杆菌(*Bacillus firmus*)的制剂(I-1582,BioNeem,Votivo)以及以下已知的活性化合物:

[0113] 3-溴-N-{2-溴-4-氯-6-[(1-环丙基乙基)氨基甲酰基]苯基}-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-甲酰胺、4-{[(6-溴吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮、4-{[(6-氟吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮、4-{[(2-氯-1,3-噻唑-5-基)甲基](2-氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮、4-{[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](甲基)氨基}呋喃-2(5H)-酮、4-{[(5,6-二氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮、4-{[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](环丙基)-氨基}呋喃-2(5H)-酮、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](环丙基)氨基}呋喃-2(5H)-酮、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](甲基)氨基}呋喃-2(5H)-酮、{[1-(6-氯吡啶-3-基)乙基](甲基)氧代- $\lambda$ 4-硫代}氰胺及其非对应异构体{[(1R)-1-(6-氯吡啶-3-基)乙基](甲基)氧代- $\lambda$ 4-硫代}氰胺(A)和{[(1S)-1-(6-氯吡啶-3-基)乙基](甲基)氧代- $\lambda$ 4-硫代}氰胺(B)以及虱虫啉及其非对应异构体[(R)-甲基(氧代-)]{(1R)-1-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]乙基}- $\lambda$ 4-硫代}氰胺(A1)和[(S)-甲基(氧代-)]{(1S)-1-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]乙基}- $\lambda$ 4-硫代}氰胺(A2),称为为非对映异构体组A[(R)-甲基(氧代-)]{(1S)-1-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]乙基}- $\lambda$ 4-硫代}氰胺(B1)和[(S)-甲基(氧代-)]{(1R)-1-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]乙基}- $\lambda$ 4-硫代}氰胺(B2),称为为非对映异构体组B,和11-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-12-羟基-1,4-二氧杂-9-氮杂二螺[4.2.4.2]十四-11-烯-10-酮、3-(4'-氟-2,4-二甲基联苯-3-基)-4-羟基-8-氧杂-1-氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮、1-{2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亚磺酰基]苯基}-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺、[(3S,4aR,12R,12aS,12bS)-3-[(环丙基羰基)氧基]-6,12-二羟基-4,12b-二甲基-11-氧代-9-(吡啶-3-基)-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氢-2H,11H-苯并[f]吡喃并[4,3-b]色烯-4-基]甲基环丙烷甲酸酯、2-氰基-3-(二氟甲氧基)-N,N-二甲基苯磺酰胺、2-氰基-3-(二氟甲氧基)-N-甲基苯磺酰胺、2-氰基-3-(二氟甲氧基)-N-乙基苯磺酰胺、4-(二氟甲氧基)-N-乙基-N-甲基-1,2-苯并噻唑-3-胺-1,1-二氧化物、N-[1-(2,3-二甲基苯基)-2-(3,5-二甲基苯基)乙基]-4,5-二氢-1,3-噻唑-2-胺、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吡啶-3,4'-哌啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮、3-(2,5-二甲基苯基)-4-羟基-8-甲氧基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮、3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基-乙基碳酸酯、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基哌啶-1-基)-5-氟嘧啶、(2,2,3,3,4,4,5,5-八氟戊基)(3,3,3-三氟丙基)丙二腈、(2,2,3,3,4,4,5,5-八氟戊基)(3,3,4,4,4-五氟丁基)丙二腈、8-[2-(环丙基甲氧基)-4-(三氟甲基)苯氧基]-3-[6-(三氟甲基)哒嗪-3-基]-3-氮杂双环[3.2.1]辛烷、2-乙基-7-甲氧基-3-甲基-6-[(2,2,3,3-四氟-2,3-二氢-1,4-苯并二噁啉-6-基)氧基]喹啉-4-基-甲基碳酸酯、2-乙基-7-甲氧基-3-甲基-6-[(2,2,3,3-四氟-2,3-二氢-1,4-苯并二噁啉-6-基)氧基]喹啉-4-基乙酸酯、PF1364(CAS登记号1204776-60-2)、5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)苯甲腈、5-[5-(2-氯吡啶-4-基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)苯甲腈、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-{2-氧代-2-[(2,2,2-三氟乙基)氨基]乙基}苯甲酰胺、4-{[(6-氯吡啶-3-

基) 甲基] (环丙基) 氨基} -1,3-噁唑-2(5H)-酮、4- {[ (6-氯吡啶-3-基) 甲基] (2,2-二氟乙基) 氨基} -1,3-噁唑-2(5H)-酮、4- {[ (6-氯吡啶-3-基) 甲基] (乙基) 氨基} -1,3-噁唑-2(5H)-酮、4- {[ (6-氯吡啶-3-基) 甲基] (甲基) 氨基} -1,3-噁唑-2(5H)-酮、NNI-0711、1-乙酰基-N-[4-(1,1,1,3,3,3-六氟-2-甲氧基丙-2-基)-3-异丁基苯基]-N-异丁酰基-3,5-二甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、2-[2-([3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基) 氨基]-5-氯-3-甲基苯甲酰基]-2-甲基肼甲酸甲酯、2-[2-([3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基) 氨基]-5-氰基-3-甲基苯甲酰基]-2-乙基肼甲酸甲酯、2-[2-([3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基) 氨基]-5-氰基-3-甲基苯甲酰基]-2-甲基肼甲酸甲酯、2-[3,5-二溴-2-([3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基) 氨基] 苯甲酰基]-1,2-二乙基肼甲酸甲酯、2-[3,5-di溴-2-([3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基) 氨基] 苯甲酰基]-2-乙基肼甲酸甲酯、(5RS,7RS;5RS,7SR)-1-(6-氯-3-吡啶基甲基)-1,2,3,5,6,7-六氢-7-甲基-8-硝基-5-丙氧基咪唑并[1,2-a]吡啶、2-{6-[2-(5-氟吡啶-3-基)-1,3-噁唑-5-基]吡啶-2-基} 嘧啶、2-{6-[2-(吡啶-3-基)-1,3-噁唑-5-基]吡啶-2-基} 嘧啶、1-(3-氯吡啶-2-基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-(甲基氨基甲酰基) 苯基]-3-{[5-(三氟甲基)-1H-四唑-1-基]甲基}-1H-吡唑-5-甲酰胺、1-(3-氯吡啶-2-基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-(甲基氨基甲酰基) 苯基]-3-{[5-(三氟甲基)-2H-四唑-2-基]甲基}-1H-吡唑-5-甲酰胺、N-[2-(叔丁基氨基甲酰基)-4-氰基-6-甲基苯基]-1-(3-氯吡啶-2-基)-3-{[5-(三氟甲基)-1H-四唑-1-基]甲基}-1H-吡唑-5-甲酰胺、N-[2-(叔丁基氨基甲酰基)-4-氰基-6-甲基苯基]-1-(3-氯吡啶-2-基)-3-{[5-(三氟甲基)-2H-四唑-2-基]甲基}-1H-吡唑-5-甲酰胺和(1E)-N-[ (6-氯吡啶-3-基) 甲基]-N'-氰基-N-(2,2-二氟乙基) 乙脒。

[0114] 在此以其“常用名”列出的活性成分是已知的并且例如描述于农药手册(“The Pesticide Manual”第16版,英国作物保护委员会,2012)或者可在互联网中检索(例如 <http://www.alanwood.net/pesticides>)。

[0115] 在本发明的优选实施方案中,即尤其是当将一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮用于促进一种或更多种农用化学活性成分渗透至植物中时,则一种或更多种农用化学活性成分在根据本发明的用途的情况下选自系统性(systemisch)农用化学活性成分,即由植物通过叶或经过根吸收并且在植物的汁液流(植物的转运系统)中传递的农用化学活性成分。

[0116] 其中,一种或更多种农用化学活性成分,尤其是在根据本发明的用于促进渗透至植物中的用途的情况下,选自具有Log P值 $\leq 4.5$ (根据EEC指令79/831附件V.A8通过HPLC,梯度方法,乙腈/0.1重量%磷酸水溶液测定)的农用化学活性成分。特别优选地,一种或更多种农用化学活性成分在根据本发明的用于促进渗透至植物中的用途的情况下选自具有Log P值 $\leq 4.5$ 并且 $\geq -2.0$ ,尤其优选Log P值 $\leq 4.5$ 并且 $\geq 0.1$ ,极其优选具有Log P值 $\leq 4.5$ 并且 $\geq 0.5$ 并且非常特别优选Log P值 $\leq 3.0$ 并且 $\geq 0.5$ 的农用化学活性成分。

[0117] 在特别优选的实施方案中,一种或更多种农用化学活性成分在根据本发明的用途的情况下,并且尤其在根据本发明的用于促进渗透至植物中的用途的情况下,选自甲氧基丙烯酸酯类杀真菌剂,优选嘧菌酯、吡唑醚菌酯、Pycoxystrobin、氟嘧菌酯、肟醚菌胺(Oryzastrobins)、啉菌酯、肟菌酯,唑类杀真菌剂,优选丙硫菌唑、戊唑醇、环菌唑、苯醚甲环唑、叶菌唑、丙环唑、四氟醚唑、三环唑,和其它活性成分,优选氟唑菌酰胺、烟酰胺、联苯

三唑醇、咪鲜胺、硫菌灵、百菌清、烯酰吗啉、丁苯吗啉、螺环菌胺、氟乐灵、噻草酮、苯嘧磺草胺、噁唑禾草灵、Acetolachlor、精异丙甲草胺、二甲戊灵、唑啉草酯、氯氟吡氧乙酸、吡虫啉、噻虫啉、噻虫嗪、噻虫胺、啉虫脒、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐、高效氯氟啶菊酯、吡蚜酮、氯虫苯甲酰胺、赤霉酸、苄基氨基比林、抗倒酯、乙烯利、噻苯隆。

[0118] 在上述农用化学活性成分中再次优选的是,一种或更多种农用化学活性成分在根据本发明的用途的情况下,并且尤其在根据本发明的用于促进渗透至植物中的用途的情况下,选自甲氧基丙烯酸酯类杀真菌剂,优选嘧菌酯、吡唑醚菌酯、氟嘧菌酯、啉菌酯、肟菌酯,唑类杀真菌剂,优选丙硫菌唑、戊唑醇、环菌唑、丙环唑,和

[0119] 其它活性成分,优选氟唑菌酰胺、联苯三唑醇、咪鲜胺、百菌清、丁苯吗啉、氟乐灵、噻草酮、苯嘧磺草胺、噁唑禾草灵、Acetolachlor、精异丙甲草胺、二甲戊灵、唑啉草酯、氯氟吡氧乙酸、吡虫啉、噻虫啉、噻虫嗪、噻虫胺、啉虫脒、赤霉酸、苄基氨基比林。

[0120] 其中再次优选的是,一种或更多种农用化学活性成分在根据本发明的用途的情况下,并且尤其在根据本发明的用于促进渗透至植物中的用途的情况下,选自嘧菌酯、吡唑醚菌酯、氟嘧菌酯、肟菌酯、丙硫菌唑、戊唑醇、氟唑菌酰胺、联苯三唑醇、咪鲜胺、百菌清、丁苯吗啉、氟乐灵、噻草酮、苯嘧磺草胺、二甲戊灵、噁唑禾草灵、吡虫啉、噻虫啉、噻虫嗪、啉虫脒、赤霉酸、苄基氨基比林。

[0121] 在其它特别优选的实施方案中,一种或更多种农用化学活性成分在根据本发明的用途的情况下,并且尤其在根据本发明的用于促进渗透至非植物有害生物中的用途的情况下,选自

[0122] 拟除虫菊酯家族的杀昆虫剂,优选氯氰菊酯、溴氰菊酯、氯菊酯、氟氯氰菊酯、联苯菊酯、高效氯氟氰菊酯、精高效氯氟氰菊酯;

[0123] 有机磷类杀昆虫剂,优选毒死蜱;

[0124] 苯甲酰胺类杀昆虫剂,优选除虫脲、虱螨脲;

[0125] 其它杀昆虫剂,优选阿维菌素、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐、氟虫酰胺、氟虫腈、氯虫苯甲酰胺、螺甲螨酯、螺螨酯、氟虫脒、茚虫威;和/或

[0126] 酰胺类杀真菌剂,优选咪鲜胺;

[0127] 其它杀真菌剂,优选肟菌酯、代森锰锌、百菌清;

[0128] 除草剂,优选乙草胺、敌稗、草胺膦。

[0129] 在上述农用化学活性成分中再次优选的是,一种或更多种农用化学活性成分在根据本发明的用途的情况下,并且尤其在根据本发明的用于促进渗透至非植物有害生物中的用途的情况下,选自

[0130] 拟除虫菊酯家族的杀昆虫剂,优选氯氰菊酯、溴氰菊酯、氟氯氰菊酯、联苯菊酯、高效氯氟氰菊酯、精高效氯氟氰菊酯;

[0131] 有机磷类杀昆虫剂,优选毒死蜱;

[0132] 苯甲酰胺类杀昆虫剂,优选除虫脲、虱螨脲;

[0133] 其它杀昆虫剂,优选阿维菌素、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐、氟虫酰胺、氟虫腈、氯虫苯甲酰胺、螺甲螨酯、螺螨酯、氟虫脒;

[0134] 酰胺类杀真菌剂,优选咪鲜胺;

[0135] 其它杀真菌剂,优选肟菌酯、代森锰锌、百菌清;

[0136] 除草剂,优选乙草胺、敌稗、草胺膦。

[0137] 其它特别优选的农用化学活性成分在根据本发明的用途的情况下包括 Fenpicoxamid、联苯吡菌胺、吡唑萘菌胺氟吡菌酰胺、吡噻菌胺和阿维菌素。

[0138] 在根据本发明的用途的情况下使用的植物保护剂可以含有一种或更多种添加物。

[0139] 优选的添加物为表面活性剂、非极性或极性溶剂、助溶剂、粘接剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、其它渗透剂、防腐剂、漂移抑制剂、填料、载剂、着色剂、蒸发抑制剂、影响pH值的试剂(缓冲剂、酸和碱)、影响粘度的试剂(例如增稠剂)、功能聚合物、佐剂和/或消泡剂。

[0140] 在优选的实施方案中,在根据本发明的用途的情况下使用的植物保护剂含有一种或更多种前述添加物。

[0141] 添加物的优选的组为表面活性剂。在这种情况下为阴离子活性的、非离子源的、阳离子活性的和/或两性离子的表面活性剂。这样的表面活性剂的实例如下文所列举(其中各自地出于制备的观点或者相应的氧化亚烷基单元在表面活性剂分子中,E0=氧化乙烯单元,P0=氧化丙烯单元,和B0=氧化丁烯单元):

[0142] 可以使用阴离子活性的表面活性剂,例如:

[0143] 1) 具有10-24个碳原子的脂肪醇的阴离子衍生物,其具有任意顺序的0-60个E0和/或0-20个P0和/或0-15个B0,其为醚羧酸根、磺酸根、硫酸根和磷酸根及其无机盐(例如碱金属和碱土金属)和有机盐(例如基于胺或烷醇胺)的形式,如来自Clariant的 **Genapol**<sup>®</sup>

LRO, **Sandopan**<sup>®</sup> 商标, **Hostaphat/Hordaphos**<sup>®</sup> 商标;

[0144] 2) 具有400至10<sup>8</sup>的分子量的由E0单元、P0单元和/或B0单元组成的共聚物的阴离子衍生物,其为醚羧酸根、磺酸根、硫酸根和磷酸根及其无机盐(例如碱金属和碱土金属)和有机盐(例如基于胺或烷醇胺)的形式;

[0145] 3) C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>醇的氧亚烷基加合物的阴离子衍生物,其为醚羧酸根、磺酸根、硫酸根和磷酸根及其无机盐(例如碱金属和碱土金属)和有机盐(例如基于胺或烷醇胺)的形式;脂肪醇烷基化物的阴离子衍生物,其为醚羧酸根、磺酸根、硫酸根和磷酸根及其无机盐(例如碱金属和碱土金属)和有机盐(例如基于胺或烷醇胺)的形式;

[0146] 4) 烷基化的芳族磺酸的盐,例如 **Phenylsulfonat**<sup>®</sup> 或 **Calsogen**<sup>®</sup> 商标。

[0147] 可以使用阳离子活性或两性离子表面活性剂,例如:

[0148] 1) 具有8至22个碳原子(C<sub>8</sub>-C<sub>22</sub>)的脂肪胺、季铵化合物的氧化亚烷基加合物,例如商标 **Genamin**<sup>®</sup> C、L、O、T 商标;

[0149] 2) 表面活性的两性离子化合物,如 **Tegotain**<sup>®</sup> 商标、**Hostapon**<sup>®</sup> T 商标和 **Arkopon**<sup>®</sup> T 商标的牛磺酸、甜菜碱和磺基甜菜碱。

[0150] 还可以使用非离子源的表面活性剂,例如:

[0151] 1) 端基封闭的和端基未封闭的脂肪醇,其具有8-24个碳原子和任意顺序的0-60个E0和/或0-20个P0和/或0-15个B0。这类化合物的实例为 **Genapol**<sup>®</sup> C、L、O、T、UD、UDD、X、XM 商标, **Plurafac**<sup>®</sup> 商标和 **Lutensol**<sup>®</sup> A、AT、ON、TO 商标, **Marlipal**<sup>®</sup> 24 和 013 商标,

**Dehypon<sup>®</sup>** 商标, **Ethylan<sup>®</sup>** 商标, 如 **Ethylan CD 120**;

[0152] 2) 脂肪酸烷氧基化物和甘油三酯烷氧基化物, 如 **Serdox<sup>®</sup>** NOG 商标或 **Emulsogen<sup>®</sup>** 商标;

[0153] 3) 脂肪酸酰胺烷氧基化物, 如 **Comperlan<sup>®</sup>** 商标;

[0154] 4) 炔二醇 (Alkindiol) 的氧化亚烷基加合物, 如 **Surfynol<sup>®</sup>** 商标; 糖衍生物, 如氨基糖和酰氨基糖;

[0155] 5) 山梨(糖)醇;

[0156] 6) 基于有机硅或者硅烷的表面活性的化合物, 如 **Tegopren<sup>®</sup>** 商标和 **SE<sup>®</sup>** 商标, 以及 **Bevaloid<sup>®</sup>** 商标、**Rhodorsil<sup>®</sup>** 商标和 **Silcolapse<sup>®</sup>** 商标;

[0157] 7) 界面活性的磺酰胺;

[0158] 8) 界面活性的聚丙烯酰衍生物和聚甲基丙烯酰衍生物, 如 **Sokalan<sup>®</sup>** 商标;

[0159] 9) 表面活性的聚酰胺, 如改性的明胶或衍生的聚天冬氨酸及其衍生物;

[0160] 10) 表面活性聚乙烯基化合物, 如改性的 PVP, 如 **Luviskol<sup>®</sup>** 商标和 **Agrimer<sup>®</sup>** 商标, 或衍生的聚乙酸乙烯酯, 如 **Mowilith<sup>®</sup>** 商标, 或聚丁酸乙烯酯, 如 **Lutonal<sup>®</sup>** 商标、**Vinnapas<sup>®</sup>** 商标和 **Pioloform<sup>®</sup>** 商标, 或改性的聚乙烯醇, 如 **Mowiol<sup>®</sup>** 商标;

[0161] 11) 表面活性的聚合物, 其基于马来酸酐和/或马来酸酐的反应产物以及包含马来酸酐和/或马来酸酐的反应产物的共聚物, 如 **Agrimer<sup>®</sup>**-VEMA 商标;

[0162] 12) 褐煤蜡、聚乙烯蜡和聚丙烯蜡的表面活性的衍生物, 如 **Hoechst<sup>®</sup>** 蜡或 **Licowet<sup>®</sup>** 和 **Licowax<sup>®</sup>** 商标;

[0163] 13) 基于多元醇的氧化亚烷基加合物, 如 **Polyglykol<sup>®</sup>** 商标;

[0164] 14) 界面活性的聚甘油酯及其衍生物;

[0165] 15) 烷基多糖及其混合物, 例如来自 **Atplus<sup>®</sup>** 系列, 优选 **Atplus<sup>®</sup>** 435;

[0166] 16) **Agnique<sup>®</sup>**-PG 商标形式的烷基多糖苷, 例如 **Agnique<sup>®</sup>**-PG 8107 (脂肪醇 C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>-葡糖苷);

[0167] 17) **Span<sup>®</sup>** 商标或 **Tween<sup>®</sup>** 商标形式的失水山梨醇酯;

[0168] 18) 环糊精酯或环糊精醚;

[0169] 19) 表面活性的纤维素衍生物和藻酸衍生物、果胶衍生物和瓜尔胶衍生物, 如 **Tylose<sup>®</sup>** 商标、**Manutex<sup>®</sup>** 商标和瓜尔胶衍生物;

[0170] 20) 基于 C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>-脂肪醇的烷基多糖苷-烷基多糖混合物, 如 **Glucopon<sup>®</sup>** 225DK 和 **Glucopon<sup>®</sup>** 215CSUP;

[0171] 21) 烷氧基化的多芳基酚化合物,如三苯乙烯基取代的酚,例如**Emulsogen**<sup>®</sup> TS 商标的形式;

[0172] 22) 由氧化乙烯和氧化丙烯组成的烷基化的共聚物,例如**Emulsogen**<sup>®</sup> 3510;

[0173] 23) 基于氧化乙烯和氧化丙烯构成的氧化亚烷基的二嵌段共聚物和三嵌段共聚物,平均摩尔质量为介于200和10000之间,优选1000至4000g/mol,其中聚乙氧基化的嵌段的质量份额在介于10和80%之间变化,例如来自**Synperonic**<sup>®</sup> PE系列(Uniqema)、**Pluronic**<sup>®</sup> PE系列(BASF)、**VOP**<sup>®</sup> 32系列或**Genapol**<sup>®</sup> PF系列(Clariant),特别优选例如**Genapol**<sup>®</sup> 10500的产品。

[0174] 优选的非离子源的表面活性剂还有烷基葡糖酰胺并且优选来自具有12至22个碳原子的脂肪酸的N-甲基葡糖酰胺。

[0175] 作为非极性溶剂,可以使用非极性有机溶剂和/或非极性无机溶剂或其混合物。

[0176] 在本发明的意义上,非极性溶剂的实例为

[0177] -脂族或芳族烃,例如矿物油或者甲苯、二甲苯和萘衍生物,

[0178] -卤化的脂族或芳族烃,如二氯甲烷或氯苯,

[0179] -油,例如基于植物的油,如玉米油和菜籽油,或油衍生物,如菜籽油甲酯。

[0180] 助溶剂可以为单独的溶剂或者两种或更多种溶剂的混合物。适合于此的是与含水农药组合物相容并且形成均质相的所有极性溶剂。合适的助溶剂例如为一元醇,如甲醇、乙醇、丙醇类、丁醇类、四氢糠醇、苯甲醇,或其它多元醇,如乙二醇、二乙二醇或甘油,或聚二醇,如聚乙二醇、聚丙二醇或混合的聚亚烷基二醇(PAG)。其它合适的溶剂为醚,例如二乙二醇二乙醚(二甘醇二乙醚)、四乙二醇二甲醚(四甘醇二甲醚)、丙二醇单甲醚、丙二醇二甲醚、二丙二醇单甲醚或二丙二醇二甲醚,酰胺,例如二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺、N-甲基吡咯烷酮或N-乙基吡咯烷酮、二甲基乳酸酰胺、二甲基辛酸酰胺、二甲基壬酸酰胺或二甲基癸酸酰胺、二甲基乳酸酰胺,碳酸酯,例如碳酸亚乙酯、碳酸亚丙酯、碳酸亚丁酯或碳酸甘油酯或其它助溶剂,如辛酸甲酯/癸酸甲酯、5-(二甲基氨基)-2-甲基-5-氧代戊酸甲酯(例如Rhodiasolv Polarclean)、1,3-二氧戊环、 $\gamma$ -丁内酯、环己酮。

[0181] 在优选的实施方案中,在根据本发明的用途的情况下使用的植物保护剂不含有助溶剂。

[0182] 在根据本发明的用途的情况下使用的植物保护剂可以含有作为添加物的任选的防腐剂。防腐剂可以为单独的防腐剂或为两种或更多种防腐剂的混合物。作为防腐剂,可以使用有机酸及其酯,例如抗坏血酸、抗坏血酸棕榈酸酯、山梨酸酯、苯甲酸、4-羟基苯甲酸甲酯、4-羟基苯甲酸丙酯、丙酸酯、苯酚、2-苯基酚盐、1,2-苯并异噻唑啉-3-酮、甲醛、亚硫酸及其盐。作为实例提及**Mergal**<sup>®</sup> K9N(Riedel)或**Cobate**<sup>®</sup> C。

[0183] 在根据本发明的用途的情况下使用的植物保护剂可以含有作为添加物的任选的漂移抑制剂。漂移抑制剂可以为单独的漂移抑制剂或为两种或更多种漂移抑制剂的混合物。作为漂移抑制剂,可以使用水溶性聚合物,例如聚甘油酯、聚丙烯酰胺、丙烯酰胺/丙烯酸聚合物、聚丙烯酸钠、羧甲基纤维素、羟乙基纤维素、甲基纤维素、多糖、天然和合成瓜尔

胶。此外还可以将特定的乳液或自乳化的体系用作漂移抑制剂。作为实例在此提及Clariant的**Synergen**<sup>®</sup> OS或者**InterLock**<sup>®</sup> (Winfield)。

[0184] 作为在根据本发明的用途的情况下使用的植物保护剂中可以含有的添加物的功能聚合物为具有大于10,000的摩尔质量的合成或天然来源的高分子化合物。功能聚合物可以例如充当抗飘移剂或提高防水性。

[0185] 在本发明的另一优选实施方案中,在根据本发明的用途的情况下使用的植物保护剂含有作为添加物的一种或更多种佐剂,如可以以已知的方式用于含水活性成分组合物的那些。

[0186] 优选地,其为脂肪胺乙氧基化物、醚胺乙氧基化物、烷基甜菜碱或酰氨基烷基甜菜碱、氧化胺或酰氨基烷基氧化胺、烷基聚糖苷或由甘油、椰子脂肪酸和邻苯二甲酸组成的共聚物。

[0187] 这些佐剂由文献中已知作为含水农药组合物中的佐剂并且例如描述于W02009/029561中。

[0188] 在根据本发明的用途的情况下使用的植物保护剂可以含有作为添加物的任选的消泡剂。消泡剂可以为单独的消泡剂或为两种或更多种消泡剂的混合物。作为消泡剂,适合的是脂肪酸烷基酯烷氧基化物;有机聚硅氧烷,如聚二甲基硅氧烷及其与微细、任选硅烷化的二氧化硅的混合物;全氟烷基膦酸酯;全氟烷基次膦酸酯;链烷烃;蜡和微晶蜡及其与硅烷化二氧化硅的混合物。还有利的是各种抑泡剂的混合物,例如来自硅油、石蜡油和/或蜡的那些。

[0189] 如前所述,可以将一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮在根据本发明的用途的情况下用于植物保护剂中。

[0190] 这可以例如以液体或固体的经浓缩的植物保护剂的形式(例如“即用型(ready-to-use)”、“罐装(in-can)”或“内装(built-in)”制剂)进行,其中浓缩物制剂通常在使用前进行稀释,尤其是用水稀释,然后通过喷雾施加作为喷雾液施加在田地上。

[0191] 水溶性浓缩物(可溶性液体,缩写为SL)在这种情况下为植物保护剂的重要形式。它们尤其在除草剂的情况下具有重要作用,其中它们经常作为水溶性盐的形式使用,所述盐通过将除草剂的酸形式用合适的碱中和转变成它们的碱金属盐或铵盐。在某些情况下,第二非水溶性农用化学活性成分也包含在植物保护剂中。那么它是悬浮浓缩物(SC),即使农用化学活性成分溶解在水相中。

[0192] 待考虑的制剂类型包括施加至植物或其增殖材料上的所有制剂。用于其制备的方法通常是本领域技术人员熟知的并且例如描述于Winnacker-Küchler,“Chemische Technologie”,第7卷,C.Hanser Verlag,慕尼黑,第4版,1986;J.W.van Valkenburg,“Pesticide Formulations”,Marcel Dekker N.Y.,1973;K.Martens,“Spray Drying Handbook”,第3版,1979,G.Goodwin Ltd.,London;或Mollet,Grubenmann,“Formulierungstechnik”,Wiley-VCH-Verlag,Weinheim,2000中。

[0193] 制剂类型的实例为“Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides”(FAO和WHO,2002,附件E)中所提及的全部那些(分别使用具有英文缩写和名称的GCPF制剂代码):AB谷物诱饵;AE气溶胶分配器;AL任何其它液体;AP任何其它粉末;CF用于种子处理的胶囊悬浮液;CG包封的颗粒;CL接触液体或凝胶;CP接

触粉末;CS胶囊悬浮液;DC可分散浓缩物;DP可撒粉粉末;DS用于干种子处理的粉末;DT用于直接施加的片剂;EC乳液浓缩物;ED可充电液体;EG可乳化颗粒;EO油包水乳液;EP可乳化粉末;ES浸种乳液;EW水包油乳液;FG细颗粒;FS种子处理用多相浓缩物;GF用于种子处理的凝胶;GC大颗粒;GL可乳化凝胶;GP漂浮粉剂;GR颗粒;GS油脂;GW水溶性凝胶;HN热雾浓缩物;KK复合包装固体/液体;KL复合包装液体/液体;KN冷雾浓缩物;KP复合包装固体/固体;LA漆;LS用于种子处理的溶液;ME微乳液;MG微颗粒;OD油分散体;OF油可混溶的可流动浓缩物/油可混溶的悬浮液;OL油可混溶的液体;OP油可分散的粉末;PA糊剂;PC凝胶或糊剂浓缩物;PO浇淋;PR植物小棒;PS涂覆有农药的种子;PT粒料;RB诱饵(即用型);SA点涂(Spot-on);SC悬浮液浓缩物;SD用于直接施加的悬浮液浓缩物;SE悬乳液;SG水溶性颗粒;SL水溶性浓缩物;SO铺展性油;SP水溶性粉末;SS用于种子处理的水溶性粉末;ST水溶性片剂;SU超低体积(ULV)悬浮液;TB片剂;TC技术材料;TK技术浓缩物;UL超低体积(ULV)液体;VP蒸汽释放产物;WG水分散性颗粒;WP可润湿粉剂;WS用于淤浆种子处理的水分散性粉末;WT水分散性片剂;XX其它。

[0194] 优选的是液体制剂类型。在此包括制剂类型DC(用于可分散浓缩物的GCPF制剂代码);EC(用于乳液浓缩物的GCPF制剂代码);EW(用于水包油乳液的GCPF制剂代码);ES(用于浸种乳液的GCPF制剂代码);FS(用于种子处理用多相浓缩物的GCPF制剂代码);EO(用于油包水乳液的GCPF制剂代码);ME(用于微乳液的GCPF制剂代码);OD(用于油分散体的GCPF制剂代码);SE(用于悬乳液的GCPF制剂代码);SL(用于水溶性浓缩物的GCPF制剂代码);CS(用于胶囊悬浮液的GCPF制剂代码)和AL(用于即用的液体制剂、用于未稀释的应用的其它液体的GCPF制剂代码)。

[0195] 特别优选的是乳液浓缩物(制剂类型EC)、水溶性浓缩物(制剂类型SL)、油分散体(制剂类型OD)、悬乳液(制剂类型SE)、微乳液(制剂类型ME)和水包油乳液(制剂类型EW)。

[0196] 同样如上所述,根据本发明的一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮的用途也可以在所谓的桶混方法中进行。

[0197] 在一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮用于促进农用化学活性成分渗透至植物中或非植物有害生物中的根据本发明的用途将一种或更多种农用化学活性成分同时优选用于控制和/或防治不希望的植物生长,植物中的真菌病或昆虫侵害,并且特别优选用于控制和/或防治不希望的植物生长。

[0198] 根据本发明的经处理的植物可以为栽培植物,即经济作物和观赏植物,或为有害植物。有害植物在此包括例如所有类型的杂草。这些栽培植物中优选的是经济上重要的经济作物,例如水果,如苹果或梨,谷物,如小麦、大麦、黑麦、燕麦、小米、大米、木薯和玉米,或花生、甜菜、棉花、大豆、油菜、马铃薯、西红柿、豌豆,以及其它蔬菜种类和观赏植物的作物如插花或观赏树木。经济作物和观赏植物的农作物例如还可以是转基因农作物,例如转基因玉米或转基因大豆。

[0199] 根据本发明经处理的非植物有害生物为昆虫,线虫,植原体,细菌如假单胞菌科、根瘤菌科、肠杆菌科、棒状杆菌科和链霉菌科,植物致病真菌,病毒和类病毒。

[0200] 温度对植物中的物质吸收具有主要影响,其中温度升高导致角质层中的迁移率增加。尤其是在植物中的物质吸收的情况下,角质层中的组织移动性是非常依赖于温度的过程,但是在非植物有害生物中的物质吸收的情况下在通过昆虫皮肤或真菌细胞壁扩散时,



并且通常在主要存在的所谓的被动扩散通过生物膜的情况下,温度起作用。溶剂,如羧酸酰胺或脂肪酸的烷基酯,如油酸甲酯可以如温度升高那样起作用,因为它们非常快地渗入角质层并且由此可以使角质层溶胀。因此,它们尤其在植物的角质层中起作用并且经常在植物表面上留下大部分活性成分。然后,这通常是结晶的,被所使用的水的矿物质包裹或以其它方式固定,并且不再可用于输送至植物或非植物有害生物中的目标位置。通常,由于较高的活性成分浓度或浓度梯度,渗透率在施用即刻为最高,并且由于在低的温度下通过植物或非植物有害生物的皮肤结构的温度依赖性扩散而经常不足。因此,农业化学活性物质在植物或非植物有害生物中的渗透率尤其在冷的温度下与较高温度相比要低得多。因为通常由于损失过程如在光中降解或挥发性或耐雨性并且为了最小化必要的物质引入,出于成本原因和环境原因通常希望加速的吸收,所以尤其寻求在低的温度的情况下促进物质吸收的可能性。

[0201] 在本发明的范围内,此外出人意料地发现,一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮即使在低的温度的情况下也以有利的方式适合于促进一种或更多种农用化学活性成分渗透至植物中或非植物有害生物中并且优选植物中。

[0202] 这例如是在持久的寒冷天气的情况下是有利的,但是当农业中的温度暂时处于寒冷范围(除了在热带地区占优势的昼夜过程以外),即如果它在白天相对温暖,但温度在夜间显着下降时也是有利的。

[0203] 当渗透至少暂时在低于或等于25℃的温度,特别优选至少暂时在低于或等于20℃的温度,尤其优选至少暂时在低于或等于15℃的温度并且及其优选至少暂时在低于或等于10℃的温度进行时,本发明因此尤其还使得一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮用于促进一种或更多种农用化学活性成分渗透至植物中或非植物有害生物中,优选用于促进渗透至植物中的用途成为可能。

[0204] 在本发明的优选实施方案中,因此在一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮用于促进一种或更多种农用化学活性成分渗透至植物中或至非植物有害生物中,并且优选用于促进一种或更多种农用化学活性成分渗透至植物中的根据本发明的用途的情况下,渗透至少暂时在低于或等于25℃的温度,优选至少暂时在低于或等于20℃的温度,特别优选至少暂时在低于或等于15℃的温度,并且尤其优选至少暂时在低于或等于10℃的温度进行。

[0205] 本发明的另外的主题还有用于促进农用化学活性成分渗透至植物中或非植物有害生物中的方法,其中将一种或更多种农用化学活性成分与一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮同时或顺序地施加在植物上。在该根据本发明的方法中,那些式(I)的N-取代的吡咯烷酮、农用化学活性成分、使用形式(植物保护剂或桶混使用和喷雾液)、添加物、植物和非植物有害生物转而优选的是在一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮用于促进农用化学活性成分渗透至植物或非植物有害生物中的根据本发明的用途的情况下也优选的那些。

[0206] 如在根据本发明的用途的情况下那样,在本发明的优选实施方案中,用于促进农用化学活性成分渗透至植物中或非植物有害生物中,并且优选用于促进农用化学活性成分渗透至植物中的根据本发明的方法至少暂时在低于或等于25℃的温度,优选至少暂时在低于或等于20℃的温度,特别优选至少暂时在低于或等于15℃的温度,并且尤其优选至少暂时在低于或等于10℃的温度进行。

[0207] 本发明的另外的主题还有上文描述的植物保护剂,其可以在一种或多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮用于促进农用化学活性成分渗透至植物中或非植物有害生物中的根据本发明的用途的情况下使用。

[0208] 这些根据本发明的植物保护剂中转而优选的是在一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮用于促进农用化学活性成分渗透至植物中或非植物有害生物中的根据本发明的用途的情况下也优选的那些。

[0209] 在本发明的优选实施方案中,根据本发明的植物保护剂含有

[0210] a) 1至90重量%并且优选5至70重量%的一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮,和

[0211] b) 1至90重量%并且优选2.5至70重量%的一种或更多种农用化学活性成分。

[0212] 上述根据本发明的植物保护剂可以含有一种或更多种添加物。它们含有优选0至98重量%并且特别优选1至60重量%的一种或更多种添加物。

[0213] 在本发明的另一优选实施方案中,根据本发明的植物保护剂含有

[0214] a) 1至50重量%,优选5至40重量%并且特别优选5至30重量%的一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮,和

[0215] b) 1至90重量%,优选5至60重量%并且特别优选2.5至50重量%的一种或更多种农用化学活性成分。

[0216] 上述根据本发明的植物保护剂可以含有一种或更多种添加物。它们含有优选0至98重量%并且特别优选1至50重量%的一种或更多种添加物。

[0217] 在本发明的另一优选实施方案中,根据本发明的植物保护剂含有水。

[0218] 本发明的另一优选实施方案中,根据本发明的植物保护剂以含水喷雾液形式存在并且含有

[0219] a) 0.001至99重量%,优选0.01至50重量%并且特别优选0.02至1重量%的一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮,和

[0220] b) 0.001至10重量%,优选0.002至5重量%并且特别优选0.0025至3重量%的一种或更多种农用化学活性成分。

[0221] 已出人意料地发现,根据本发明的植物保护剂适合于制备具有非常低的活性成分含量的高效喷雾液。本发明因此还涉及含有上述组分a)和b)的含水喷雾液,其中组分b)的含量为小于0.05g/l,优选0.01至0.03g/l。

[0222] 在具有低的活性成分含量的该喷雾液的特别优选的实施方案中,组分a)的含量为小于0.1重量%,特别优选0.015至0.05重量%,基于喷雾液的总量计。

[0223] 上述根据本发明的含水喷雾液形式的植物保护剂可以含有一种或更多种添加物。它们含有优选0至99重量%并且特别优选0.01至80重量%的一种或更多种添加物。

[0224] 在根据本发明的植物保护剂中,式(I)的N-取代的吡咯烷酮、农用化学活性成分和任选含有的添加物尤其优选的是在一种或更多种式(I)的N-取代的吡咯烷酮用于促进农用化学活性成分渗透至植物中或非植物有害生物中的根据本发明的用途的情况下也优选的那些。

[0225] 如在根据本发明的用途的情况下,涉及式(I)的N-取代的吡咯烷酮、农用化学活性成分和添加物的量的值基于根据本发明的植物保护剂的总重量计,并且在农用化学活性成

分为质子化形式的酸但是以其水溶性盐形式使用的情况下,基于游离酸的量计,即所谓的酸当量("acid equivalent", a.e.)。

[0226] 在根据本发明的用途中作为优选描述的农用化学活性成分也在根据本发明的植物保护剂中作为组分b) 优选地使用。

[0227] 优选的组分b) 选自杀真菌剂、杀菌剂、杀昆虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、除草剂、植物生长调节剂、植物营养物、驱避剂、杀软体动物剂和灭鼠剂。特别优选的组分b) 选自除草剂、杀真菌剂、杀昆虫剂、杀线虫剂和/或植物生长调节剂。

[0228] 本发明特别优选涉及植物保护剂,其除了组分a) 以外含有作为组分b) 的选自以下的一种或更多种农用化学活性成分

[0229] 甲氧基丙烯酸酯类杀真菌剂,优选嘧菌酯、吡唑醚菌酯、Pycoxystrobin、氟嘧菌酯、肟醚菌胺、啉菌酯、肟菌酯,和/或

[0230] 唑类杀真菌剂,优选丙硫菌唑、戊唑醇、环菌唑、苯醚甲环唑、叶菌唑、丙环唑、四氟醚唑、三环唑,和/或

[0231] 其它活性成分,优选Fenpicoxamid、氟唑菌酰胺、烟酰胺、联苯三唑醇、咪鲜胺、硫菌灵、百菌清、联苯吡菌胺、吡唑萘菌胺、氟吡菌酰胺、吡噻菌胺、烯酰吗啉、丁苯吗啉、螺环菌胺、氟乐灵、噻草酮、苯嘧磺草胺、噁唑禾草灵、Acetolachlor、精异丙甲草胺、二甲戊灵、唑啉草酯、氯氟吡氧乙酸、阿维菌素、吡虫啉、噻虫啉、噻虫嗪、噻虫胺、啉虫脒、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐、高效氯氟啶菊酯、吡蚜酮、氯虫苯甲酰胺、赤霉酸、苄基氨基比林、抗倒酯、乙烯利、噻苯隆。

[0232] 非常特别优选作为组分b) 使用的农用化学活性成分选自

[0233] 甲氧基丙烯酸酯类杀真菌剂,优选嘧菌酯、吡唑醚菌酯、氟嘧菌酯、啉菌酯、肟菌酯,和/或

[0234] 唑类杀真菌剂,优选丙硫菌唑、戊唑醇、环菌唑、丙环唑、叶菌唑,和/或

[0235] 其它活性成分,优选Fenpicoxamid、氟唑菌酰胺、联苯三唑醇、咪鲜胺、百菌清、联苯吡菌胺、吡唑萘菌胺、氟吡菌酰胺、吡噻菌胺、丁苯吗啉、氟乐灵、噻草酮、苯嘧磺草胺、噁唑禾草灵、Acetolachlor、精异丙甲草胺、二甲戊灵、唑啉草酯、氯氟吡氧乙酸、阿维菌素、吡虫啉、噻虫啉、噻虫嗪、噻虫胺、啉虫脒、赤霉酸、抗倒酯、苄基氨基比林。

[0236] 尤其优选作为组分b) 使用的农用化学活性成分选自嘧菌酯、吡唑醚菌酯、氟嘧菌酯、肟菌酯、丙硫菌唑、戊唑醇、氟唑菌酰胺、联苯三唑醇、叶菌唑、咪鲜胺、百菌清、丁苯吗啉、氟乐灵、噻草酮、苯嘧磺草胺、二甲戊灵、噁唑禾草灵、吡虫啉、噻虫啉、噻虫嗪、啉虫脒、苄基氨基比林;和/或选自

[0237] 拟除虫菊酯家族的杀昆虫剂,优选氯氰菊酯、溴氰菊酯、氯菊酯、氟氯氰菊酯、联苯菊酯、高效氯氟氰菊酯、精高效氯氟氰菊酯;和/或

[0238] 有机磷类杀昆虫剂,优选毒死蜱;和/或

[0239] 苯甲酰脲类杀昆虫剂,优选除虫脲、虱螨脲;和/或

[0240] 其它杀昆虫剂,优选阿维菌素、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐、氟虫酰胺、氟虫腈、氯虫苯甲酰胺、螺甲螨酯、螺螨酯、氟虫腈、茚虫威;和/或

[0241] 酰胺类杀真菌剂,优选咪鲜胺;和/或

[0242] 其它杀真菌剂,优选肟菌酯、代森锰锌、百菌清;联苯吡菌胺、吡唑萘菌胺、氟吡菌

酰胺、吡嗪菌胺；和/或

[0243] 除草剂，优选乙草胺、敌稗、草胺膦；和/或植物生长调节剂，尤其是抗倒酯或赤霉素。

[0244] 在下文中通过实施例进一步阐明本发明，而不将其限制于此。

[0245] 如果没有明确另外指出，则将涉及材料量或物质质量的百分比值理解为重量百分比（重量%）。

## 实施例

[0246] 渗透测试（在植物中的渗透）

[0247] 在该测试中，通过酶法分离的苹果树叶或梨树叶的角质层测量活性成分的渗透率。

[0248] 使用以完全成熟的状态从金冠种类的苹果树或梨树切割的叶。角质层的分离以如下方式进行

[0249] -首先在下侧用染料标记并且冲压的叶片盘上借助真空渗入填充缓冲液至介于3和4之间的pH值的果胶酶溶液（0.2至2重量%），

[0250] -然后加入叠氮化钠，和

[0251] -使如此处理的叶片盘静置直至原始叶结构溶解和直至非细胞的角质层脱离。

[0252] 然后仅进一步使用叶片上侧的没有气孔和毛的角质层。将它们多次交替地用水和pH值为7的缓冲液洗涤。最后将获得的干净的角质层在聚四氟乙烯小板上张紧并且用弱空气流弄平和干燥。

[0253] 在下一步骤中，将用于膜输送研究的如此获得的角质层膜放入不锈钢制扩散池（输送室）中。为此将角质层用镊子放置在扩散池的硅脂涂覆边缘的中间，并用同样润滑的环密封。如此选择布置，使得角质层的形态上的外侧朝外，即朝向空气，而原始内侧面向扩散池的内部。将扩散池用水或者用水与溶剂的混合物填充。

[0254] 为了测定渗透率，将各9μl在实施例中提及的组成的喷雾液施加在角质层的外侧上。

[0255] 在喷雾液中各自使用CIPAC水。

[0256] 在施加喷雾液之后，各自使水蒸发，然后分别转动所述室并且将其安放在恒温浴中，其中在角质层的外侧上吹送具有限定的温度和空气湿度的空气。开始的渗透因此发生在60%的相对湿度和如给出的经设定的温度下。借助于高效液相色谱法（HPLC）测量活性成分渗透率。

[0257] 如借助在表1至20中进行的实施例看出，N-（正丁基）-2-吡咯烷酮的存在导致相对于其中不存在N-（正丁基）-2-吡咯烷酮的制剂的可观的吸收增加。所使用的N-（正丁基）-2-吡咯烷酮的替代物为用于制剂的市售原料的实例。

[0258] 在下表中给出的“%渗透率”的值说明了施加在植物上的物质质量的多少百分比渗透至植物中。给出的值为平均值。

[0259] 在下表中使用的缩写具有以下含义：

[0260] 20SG：“**Mospilan**<sup>®</sup> 20SG”的缩写形式

- [0261] **Calypso**<sup>®</sup> SC 480:噻虫啉的商业制剂
- [0262] **Custodia**<sup>®</sup> SC 320:噻菌酯和戊唑醇的商业制剂
- [0263] DAT:施加之后的天数 (“Days After Treatment”)
- [0264] DF75: “**Dimetric**<sup>®</sup> DF75”的缩写形式
- [0265] **Dimetric**<sup>®</sup> DF75:噻草酮的商业制剂
- [0266] DMSO:二甲亚砜
- [0267] EC 540:氟乐灵的商业制剂
- [0268] **Galaster**<sup>®</sup> BL97:乳酸丁酯
- [0269] **Genagen**<sup>®</sup> NBP:NBP (100%)
- [0270] **Mospilan**<sup>®</sup> 20SG:啉虫脒的商业制剂
- [0271] n:处理和有关的测量的数量
- [0272] NBP:N-(正丁基)-2-吡咯烷酮
- [0273] NMP:N-甲基吡咯烷酮
- [0274] **Orkestra**<sup>®</sup> SC 500:氟唑菌酰胺和吡唑醚菌酯的商业制剂
- [0275] RT:室温 (23至25℃)
- [0276] SC320: “**Custodia**<sup>®</sup> SC 320”的缩写形式
- [0277] SC480: “**Calypso**<sup>®</sup> SC 480”的缩写形式
- [0278] SC500: “**Orkestra**<sup>®</sup> SC 500”的缩写形式
- [0279] EC 18:阿维菌素的商业制剂 (乳液浓缩物)
- [0280] SC 200:氯虫苯甲酰胺的商业制剂 (悬浮液浓缩物)
- [0281] 受体介质:氯吡脒在水-二醇介质中的溶液
- [0282] 丙硫菌唑x%RW:具有x重量%的活性成分含量的丙硫菌唑粉末
- [0283] **Genagen**<sup>®</sup> PA:二甲基壬酸酰胺
- [0284] **Genagen**<sup>®</sup> 4296:二甲基癸酸酰胺
- [0285] **Agsolex**<sup>®</sup> 08:N-辛基吡咯烷酮
- [0286] **Solvesso**<sup>®</sup> 200ND:芳族烃的混合物
- [0287] **Emulsogen**<sup>®</sup> 3510:氧化乙烯和氧化丙烯的烷基化的共聚物
- [0288] **Synergen**<sup>®</sup> 848:氧化乙烯和氧化丙烯的烷基化的共聚物
- [0289] **Synergen**<sup>®</sup> W03:烷基磺基琥珀酸盐,在烃中的钠盐
- [0290] **Synergen**<sup>®</sup> W09:烷基磺基琥珀酸盐,在白油中的钠盐
- [0291] **Genapol**<sup>®</sup> X 090:具有9个氧化乙烯单元的异十三烷醇

- [0292] **Emulsogen**<sup>®</sup> MTP 070: 氧化乙烯和氧化丙烯的烷基化的共聚物
- [0293] **Emulsogen**<sup>®</sup> EL 300: 具有30个氧化乙烯单元的蓖麻油
- [0294] **Emulsogen**<sup>®</sup> EL 360: 具有36个氧化乙烯单元的蓖麻油
- [0295] **Momentive**<sup>®</sup> SAG 1571: 聚二甲基硅氧烷乳液
- [0296] 抗倒酯x%RW: 具有x重量%的活性成分含量的抗倒酯粉末
- [0297] **Hostaphat**<sup>®</sup> 1306: 具有6个氧化乙烯单元的异十三烷基磷酸酯
- [0298] **Emulsogen**<sup>®</sup> ELO 200: 改性的蓖麻油乙氧基化物
- [0299] **Synergen**<sup>®</sup> SOC: 桶混佐剂
- [0300] MSO: 葵花油甲酯

[0301]

实施例 1：采用噻草酮在 10℃ 在梨中的渗透试验

表 1：实施例 1 的在 6 小时之后和在 2 天之后的渗透的结果

实施例	含水喷雾液中的 制剂/测试物质(重量%)	活性成分	含水喷雾液中的 噻草酮浓度(g/l)	噻草酮在 10℃ 在梨中的%渗透率 在 6 h 之后 // n = 5 – 7	噻草酮在 10℃ 在梨中的%渗透率 在 2 DAT 之后 // n = 5 – 7
1-1	Dimetric® DF75	噻草酮	2.25	0.57	1.28
1-2	DF75/NMP (0.1)	噻草酮	2.25	0.48	1.25
1-3	DF75/NMP (0.5)	噻草酮	2.25	0.83	3.51
1-4	DF75/DMSO (0.1)	噻草酮	2.25	0.28	1
1-5	DF75/DMSO (0.5)	噻草酮	2.25	0.64	2.02
1-6	DF75/NBP (0.1)	噻草酮	2.25	1.88	3.54
1-7	DF75/NBP (0.3)	噻草酮	2.25	8.93	11.64
1-8	DF75/NBP (0.5)	噻草酮	2.25	16.88	21.05

[0302] 实施例1-1至1-8的程序：

[0303] 将制剂 (**Dimetric®**DF75或者DF75) 用水稀释,从而稀释液含有4.50g/1的噻草酮

浓度。通过在水中混合这些经稀释的制剂与对应量的测试物质 (NMP、DMSO或NBP) ,调节含水喷雾液的测试物质 (0.1重量%、0.3重量%或0.5重量%) 和农用化学活性成分噻草酮 (2.25g/l) 的期望的浓度。在10℃的温度在施加6h之后和在2天 (2DAT) 之后通过经分离的梨角质层测量渗透率。

[0304] 类似于实施例1进行实施例2至17和20至22的试验,但是考虑在表2至20中给出的数据和条件。



[0305]

实施例 2：采用噻草酮在室温在梨中的渗透试验

表 2：实施例 2 的在 6 小时之后和在 2 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质(重量%)	活性成分	含水喷雾液中的 噻草酮浓度(g/l)	噻草酮在 RT 在梨中的%渗透率 在 6 h 之后 // n = 5 - 7	噻草酮在 RT 在梨中的%渗透率 在 2 DAT 之后 // n = 5 - 7
2-1	Dimetric® DF75	噻草酮	2.25	2.93	26.81
2-2	DF75/NMP (0.1)	噻草酮	2.25	1.82	7.61
2-3	DF75/NMP (0.5)	噻草酮	2.25	5	15.84
2-4	DF75/DMSO (0.1)	噻草酮	2.25	1.82	6.9
2-5	DF75/DMSO (0.5)	噻草酮	2.25	0.94	5.47
2-6	DF75/NBP (0.1)	噻草酮	2.25	3.43	13.46
2-7	DF75/NBP (0.3)	噻草酮	2.25	8.78	18.14
2-8	DF75/NBP (0.5)	噻草酮	2.25	18.6	32.41

[0306]

实施例 3：采用噻草酮在 10℃ 在梨中的渗透试验

表 3：实施例 3 的在 6 小时之后和在 2 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质(重量%)	活性成分	在含水喷雾液中的 噻草酮浓度(g/l)	噻草酮在 10℃ 在梨中的%渗透率 在 6 h 之后 // n = 5 - 7	噻草酮在 10℃ 在梨中的%渗透率 在 2 DAT 之后 // n = 5 - 7
3-1	Dimetric® DF75	噻草酮	2.25	0.1	1.14
3-2	DF75/异佛尔酮 (0.1)	噻草酮	2.25	0.27	1.87
3-3	DF75/异佛尔酮 (0.3)	噻草酮	2.25	0.24	1.54
3-4	DF75/异佛尔酮 (0.5)	噻草酮	2.25	0.45	4.13
3-5	DF75/NBP (0.1)	噻草酮	2.25	0.86	1.86
3-6	DF75/NBP (0.3)	噻草酮	2.25	6.63	11.45
3-7	DF75/NBP (0.5)	噻草酮	2.25	14.7	20.79

[0307]

实施例 4：采用噻菌酯在 10°C 在苹果中渗透试验

表 4：实施例 4 的在 6 小时之后和在 3 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质 (重量%)	活性成分	在含水喷雾液中的 噻菌酯浓度(g/l)	噻菌酯在 10°C 在苹果中的%渗透率 在 6 h 之后 // n = 5 – 7	噻菌酯在 10°C 在苹果中的%渗透率 在 3 DAT 之后 // n = 5 – 7
4-1	Custodia® SC 320	噻菌酯和戊唑醇	0.45	0.21	0.88
4-2	SC320/NMP (0.1)	噻菌酯和戊唑醇	0.45	0 (= 不可检测)	0.72
4-3	SC320/NMP (0.5)	噻菌酯和戊唑醇	0.45	0	0.61
4-4	SC320/NBP (0.1)	噻菌酯和戊唑醇	0.45	0	0.46
4-5	SC320/NBP (0.5)	噻菌酯和戊唑醇	0.45	0.32	3.04

对于戊唑醇在 10°C 在苹果中的渗透率，参见实施例 6

[0308]

实施例 5: 采用噻菌酯在室温在苹果中的渗透试验

表 5: 实施例 5 的在 6 小时之后和在 3 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质 (重量%)	活性成分	在含水喷雾液中的 噻菌酯浓度(g/l)	噻菌酯在 RT 在苹果中的%渗透率 在 6 h 之后 // n = 5 - 7	噻菌酯在 RT 在苹果中的%渗透率 在 3 DAT 之后 // n = 5 - 7
5-1	Custodia® SC 320	噻菌酯和戊唑醇	0.45	0.54	3.61
5-2	SC320/NMP (0.1)	噻菌酯和戊唑醇	0.45	0.47	2.47
5-3	SC320/NMP (0.5)	噻菌酯和戊唑醇	0.45	1.28	8.76
5-4	SC320/NBP (0.1)	噻菌酯和戊唑醇	0.45	0.33	1.43
5-5	SC320/NBP (0.5)	噻菌酯和戊唑醇	0.45	5.06	13.85

对于戊唑醇在室温在苹果中的渗透率, 参见实施例 7

[0309]

实施例 6: 采用戊唑醇在 10°C 在苹果中的渗透试验

表 6: 实施例 6 的在 6 小时之后和在 3 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质 (重量%)	活性成分	在含水喷雾液中的 戊唑醇浓度(g/l)	戊唑醇在 10°C 在苹果中的%渗透率 在 6 h 之后 // n = 5 - 7	戊唑醇在 10°C 在苹果中的%渗透率 在 3 DAT 之后 // n = 5 - 7
6-1	Custodia® SC 320	嘧菌酯和戊唑醇	0.75	0.37	0.91
6-2	SC320/NMP (0.1)	嘧菌酯和戊唑醇	0.75	0.12	1.55
6-3	SC320/NMP (0.5)	嘧菌酯和戊唑醇	0.75	0.12	3.85
6-4	SC320/NBP (0.1)	嘧菌酯和戊唑醇	0.75	0.06	2.14
6-5	SC320/NBP (0.5)	嘧菌酯和戊唑醇	0.75	7.01	18.17

对于嘧菌酯在 10°C 在苹果中的渗透率，参见实施例 4

[0310]

实施例 7: 采用戊唑醇在室温在苹果中的渗透试验

表 7: 实施例 7 的在 6 小时之后和在 3 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质 (重量%)	活性成分	在含水喷雾液中的 戊唑醇浓度(g/l)	戊唑醇在 RT 在苹果中的%渗透率 在 6 h 之后 // n = 5 - 7	戊唑醇在 RT 在苹果中的%渗透率 在 3 DAT 之后 // n = 5 - 7
7-1	Custodia® SC 320	嘧菌酯和戊唑醇	0.75	2.54	22.72
7-2	SC320/NMP (0.1)	嘧菌酯和戊唑醇	0.75	3.67	20.73
7-3	SC320/NMP (0.5)	嘧菌酯和戊唑醇	0.75	9.2	71.3
7-4	SC320/NBP (0.1)	嘧菌酯和戊唑醇	0.75	4.27	12.41
7-5	SC320/NBP (0.5)	嘧菌酯和戊唑醇	0.75	30.4	79.6

对于嘧菌酯在室温在苹果中的渗透率，参见实施例 5

[0311]

实施例 8: 采用氟唑菌酰胺在 10°C 在苹果中的渗透试验

表 8: 实施例 8 的在 1 天之后和在 3 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质(重量%)	活性成分	在含水喷雾液中的 氟唑菌酰胺浓度(g/l)	氟唑菌酰胺在 10°C 在苹果中的%渗透率 在 1 DAT 之后 // n = 5 - 7	氟唑菌酰胺在 10°C 在苹果中的%渗透率 在 3 DAT 之后 // n = 5 - 7
8-1	Orkestra® SC 500	氟唑菌酰胺和吡唑醚菌酯	0.285	0.12	0.25
8-2	SC500/异佛尔酮 (0.3)	氟唑菌酰胺和吡唑醚菌酯	0.285	0	0.23
8-3	SC500/NBP (0.3)	氟唑菌酰胺和吡唑醚菌酯	0.285	1.45	3.0

[0312]

实施例 9：采用氟唑菌酰胺在室温在苹果中的渗透试验

表 9：实施例 9 的在 1 天之后和在 3 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质(重量%)	活性成分	在含水喷雾液中的 氟唑菌酰胺浓度(g/l)	氟唑菌酰胺在 RT 在苹果中的%渗透率 在 1 DAT 之后 // n = 5 - 7	氟唑菌酰胺在 RT 在苹果中的%渗透率 在 3 DAT 之后 // n = 5 - 7
9-1	Orkestra® SC 500	氟唑菌酰胺和吡唑醚菌酯	0.285	1.99	3.84
9-2	SC500/异佛尔酮 (0.3)	氟唑菌酰胺和吡唑醚菌酯	0.285	1.01	3.16
9-3	SC500/NBP (0.3)	氟唑菌酰胺和吡唑醚菌酯	0.285	10.14	21.39



[0313]

实施例 10：采用吡唑醚菌酯在 10°C 在梨中的渗透试验

表 10：实施例 10 的在 1 天之后和在 3 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质(重量%)	活性成分	在含水喷雾液中的 吡唑醚菌酯浓度(g/l)	吡唑醚菌酯在 10°C 在梨中的%渗透率 在 1 DAT 之后 // n = 5 - 7	吡唑醚菌酯在 10°C 在梨中的%渗透率 在 3 DAT 之后 // n = 5 - 7
10-1	Orkestra® SC 500	氟唑菌酰胺和吡唑醚菌酯	0.566	0.04	0.12
10-2	SC500/NMP (0.3)	氟唑菌酰胺和吡唑醚菌酯	0.566	0.05	0.29
10-3	SC500/DMSO (0.3)	氟唑菌酰胺和吡唑醚菌酯	0.566	0.02	0.06
10-4	SC500/NBP (0.3)	氟唑菌酰胺和吡唑醚菌酯	0.566	3.77	5.45

[0314]

实施例 11：采用吡唑醚菌酯在室温在梨中的渗透试验

表 11：实施例 11 的在 1 天之后和在 3 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质(重量%)	活性成分	在含水喷雾液中的 吡唑醚菌酯浓度(g/l)	吡唑醚菌酯在 RT 在梨中的%渗透率 在 1 DAT 之后 // n = 5 - 7	吡唑醚菌酯在 RT 在梨中的%渗透率 在 3 DAT 之后 // n = 5 - 7
11-1	Orkestra® SC 500	氟唑菌酰胺和吡唑醚菌酯	0.566	0.56	2.18
11-2	SC500/NMP (0.3)	氟唑菌酰胺和吡唑醚菌酯	0.566	2.51	9.65
11-3	SC500/DMSO (0.3)	氟唑菌酰胺和吡唑醚菌酯	0.566	0.72	2.62
11-4	SC500/NBP (0.3)	氟唑菌酰胺和吡唑醚菌酯	0.566	13.43	29.44

[0315]

实施例 12: 采用噻虫啉在 10°C 在梨中的渗透试验

表 12: 实施例 12 的在 6 小时之后和在 2 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质(重量%)	活性成分	在含水喷雾液中的 噻虫啉浓度(g/l)	噻虫啉在 10°C 在梨中的%渗透率 在 6 h 之后 // n = 5 - 7	噻虫啉在 10°C 在梨中的%渗透率 在 2 DAT 之后 // n = 5 - 7
12-1	Calypso® SC 480	噻虫啉	0.3	0.2	0.2
12-2	SC480/NMP (0.1)	噻虫啉	0.3	0.16	0.24
12-3	SC480/NMP (0.3)	噻虫啉	0.3	0.13	0.4
12-4	SC480/NMP (0.5)	噻虫啉	0.3	0.36	0.68
12-5	SC480/DMSO (0.1)	噻虫啉	0.3	0	0.2
12-6	SC480/DMSO (0.3)	噻虫啉	0.3	0	0.11
12-7	SC480/DMSO (0.5)	噻虫啉	0.3	0.06	0.17
12-8	SC480/NBP (0.1)	噻虫啉	0.3	2.16	2.78
12-9	SC480/NBP (0.3)	噻虫啉	0.3	18.25	20.96
12-10	SC480/NBP (0.5)	噻虫啉	0.3	27.29	31.53

[0316]

实施例 13：采用噻虫啉在室温在梨中的渗透试验

表 13：实施例 13 的在 6 小时之后和在 2 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质(重量%)	活性成分	在含水喷雾液中的 噻虫啉浓度(g/l)	噻虫啉在 RT 在梨中的%渗透率 在 6 h 之后 // n = 5 - 7	噻虫啉在 RT 在梨中的%渗透率 在 2 DAT 之后 // n = 5 - 7
13-1	Calypso® SC 480	噻虫啉	0.3	0.04	0.59
13-2	SC480/NMP (0.1)	噻虫啉	0.3	0.08	0.54
13-3	SC480/NMP (0.3)	噻虫啉	0.3	0.51	1.25
13-4	SC480/NMP (0.5)	噻虫啉	0.3	1.02	2.69
13-5	SC480/DMSO (0.1)	噻虫啉	0.3	0.14	1.33
13-6	SC480/DMSO (0.3)	噻虫啉	0.3	0.01	0.54
13-7	SC480/DMSO (0.5)	噻虫啉	0.3	0	0.44
13-8	SC480/NBP (0.1)	噻虫啉	0.3	2.16	3.52
13-9	SC480/NBP (0.3)	噻虫啉	0.3	23.37	29.85
13-10	SC480/NBP (0.5)	噻虫啉	0.3	34.8	44.33

[0317]

实施例 14：采用噻虫啉在 10°C 在苹果中的渗透试验

表 14：实施例 14 的在 1 天之后和在 3 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质(重量%)	活性成分	在含水喷雾液中的 噻虫啉浓度(g/l)	噻虫啉在 10°C 在苹果中的%渗透率 在 1 DAT 之后 // n = 5 - 7	噻虫啉在 10°C 在苹果中的%渗透率 在 3 DAT 之后 // n = 5 - 7
14-1	Calypso® SC 480	噻虫啉	0.3	0.31	0.77
14-2	SC480/异佛尔酮 (0.1)	噻虫啉	0.3	0.31	0.76
14-3	SC480/异佛尔酮 (0.3)	噻虫啉	0.3	0.14	0.44
14-4	SC480/异佛尔酮 (0.5)	噻虫啉	0.3	0.31	0.85
14-5	SC480/NBP (0.1)	噻虫啉	0.3	0.83	1.34
14-6	SC480/NBP (0.3)	噻虫啉	0.3	6.89	8.57
14-7	SC480/NBP (0.5)	噻虫啉	0.3	18.57	20.77

[0318]

实施例 15: 采用噻虫啉在室温在苹果中的渗透试验

表 15: 实施例 15 的在 1 天之后和在 3 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质 (重量%)	活性成分	在含水喷雾液中的 噻虫啉浓度 (g/l)	噻虫啉在 RT 在苹果中的%渗透率 在 1 DAT 之后 // n = 5 - 7	噻虫啉在 RT 在苹果中的%渗透率 在 3 DAT 之后 // n = 5 - 7
15-1	Calypso® SC 480	噻虫啉	0.3	0.46	1.48
15-2	SC480/异佛尔酮 (0.1)	噻虫啉	0.3	0.6	1.62
15-3	SC480/异佛尔酮 (0.3)	噻虫啉	0.3	0.62	1.71
15-4	SC480/异佛尔酮 (0.5)	噻虫啉	0.3	0.33	0.87
15-5	SC480/NBP (0.1)	噻虫啉	0.3	2.68	4.69
15-6	SC480/NBP (0.3)	噻虫啉	0.3	8.86	11.62
15-7	SC480/NBP (0.5)	噻虫啉	0.3	31.27	42.15

[0319]

实施例 16: 采用啉虫脒在 10°C 在苹果中的渗透试验

表 16: 实施例 16 的在 8 小时之后和在 1 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质(重量%)	活性成分	在含水喷雾液中的 啉虫脒浓度(g/l)	啉虫脒在 10°C 在苹果中的%渗透率 在 8 h 之后 // n = 5 - 7	啉虫脒在 10°C 在苹果中的%渗透率 在 1 DAT 之后 // n = 5 - 7
16-1	Mospilan® 20 SG	啉虫脒	0.3	0.6	13.7
16-2	20 SG/NMP (0.1)	啉虫脒	0.3	0.6	14.4
16-3	20 SG/NMP (0.3)	啉虫脒	0.3	1.4	18.8
16-4	20 SG/NMP (0.5)	啉虫脒	0.3	3.6	24.2
16-5	20 SG/DMSO(0.1)	啉虫脒	0.3	1.6	15.9
16-6	20 SG/DMSO(0.3)	啉虫脒	0.3	1.5	13.4
16-7	20 SG/DMSO(0.5)	啉虫脒	0.3	2.8	22.2
16-8	20 SG/异佛尔酮 (0.1)	啉虫脒	0.3	4.2	18.1
16-9	20 SG/异佛尔酮 (0.3)	啉虫脒	0.3	4.1	24.1
16-10	20 SG/异佛尔酮 (0.5)	啉虫脒	0.3	4.5	16.2
16-11	20 SG/Galaster® BL97 (0.1)	啉虫脒	0.3	5.4	23

[0320]

续表 16: 实施例 16 的在 8 小时之后和在 1 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的制剂/ 测试物质(重量%)	活性成分	在含水喷雾液中 的啶虫脒浓度 (g/l)	啶虫脒在 10°C 在 苹果中的%渗透率 在 8 h 之后 // n = 5	啶虫脒在 10°C 在 苹果中的%渗透率 在 1 DAT 之后 // n = 5 - 7
16-12	20 SG/Galaster® BL97 (0.3)	啶虫脒	0.3	5.5	19.3
16-13	20 SG/Galaster® BL97 (0.5)	啶虫脒	0.3	6.6	22.8
16-14	20 SG/NBP (0.1)	啶虫脒	0.3	6.9	22.8
16-15	20 SG/NBP (0.3)	啶虫脒	0.3	23.9	48.1
16-16	20 SG/NBP (0.5)	啶虫脒	0.3	46.1	57.7



[0321]

实施例 17: 采用氟乐灵在 10℃ 在梨中的渗透试验

表 17: 实施例 17 的在 1 天之后和在 3 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质(重量%)	活性成分	在含水喷雾液中的 氟乐灵浓度(g/l)	氟乐灵在 10℃ 在梨中的%渗透率 在 1 DAT 之后 // n = 5 - 7	氟乐灵在 10℃ 在梨中的%渗透率 在 3 DAT 之后 // n = 5 - 7
17-1	EC 540	氟乐灵	3.5	0.53	1.31
17-2	EC 540/NMP (0.1)	氟乐灵	3.5	0.64	1.67
17-3	EC 540/NMP (0.3)	氟乐灵	3.5	0.56	1.33
17-4	EC 540/NMP (0.5)	氟乐灵	3.5	0.81	2.06
17-5	EC 540/异佛尔酮(0.1)	氟乐灵	3.5	0.76	1.97
17-6	EC 540/异佛尔酮(0.3)	氟乐灵	3.5	0.9	2.29
17-7	EC 540/异佛尔酮(0.5)	氟乐灵	3.5	0.79	2.13
17-8	EC 540/NBP (0.1)	氟乐灵	3.5	0.8	1.74
17-9	EC 540/NBP (0.3)	氟乐灵	3.5	2.43	4.49
17-10	EC 540/NBP (0.5)	氟乐灵	3.5	3.66	6.19

[0322] 实施例18:采用丙硫菌唑在10℃和20℃在梨中的渗透试验

[0323] 进行采用活性成分丙硫菌唑与 **Genagen**<sup>®</sup>NBP (N-(正丁基)-2-吡咯烷酮) 或 **Emulsogen**<sup>®</sup>EL 360 (蓖麻油乙氧基化物) 组合的试验。

[0324] 将活性成分在丙酮/水混合物中以2或0.75g/l的浓度溶解。丙硫菌唑的渗透率对于梨的叶角质层进行测量。采用添加剂体系进行试验,一方面采用乳化剂 **Emulsogen**<sup>®</sup>EL 360作为对比并且另一方面采用 **Genagen**<sup>®</sup>NBP作为具有过量的活性成分的根据本发明的试验(活性成分比添加剂的比例为约2比1)。

[0325] 在附图图1中示出实施例18的渗透试验结果。给出的结果为来自5-7次处理的测量结果的平均值。

[0326] 在图1中:

[0327] a表示丙硫菌唑 (0.75g/l) + **Genagen**<sup>®</sup>NBP (0.4g/l)

[0328] b表示丙硫菌唑 (2g/l) + **Genagen**<sup>®</sup>NBP (1g/l)

[0329] c表示丙硫菌唑 (0.75g/l) + **Emulsogen**<sup>®</sup>EL 360 (0.4g/l)

[0330] d表示丙硫菌唑 (2g/l) + **Emulsogen**<sup>®</sup>EL 360 (1g/l)

[0331] 在图1的x轴上给出以小时(h)计的施加之后的时间。

[0332] 在图1的y轴上给出渗透通过植物的角质层的活性成分的份额,其基于总的施加在植物上的活性成分的量计,以百分比(%)给出。

[0333] 渗透首先在10℃进行约1天,然后在恒定在约60%相对湿度下将温度升高至20℃。丙硫菌唑的浓度相当于实践的典型值(0.75g/l或者2g/l的丙硫菌唑)。施加液滴的水在宏观上在最迟1小时之后从叶角质层完全蒸发。采用停留在角质层或者叶片表面上的乳化剂添加剂 **Emulsogen**<sup>®</sup>EL 360,在将温度从10℃升高至20℃时,出现渗透至植物中的活性成分的量的明显增加或者渗透速率明显增加几倍。**Genagen**<sup>®</sup>NBP在此以相同的使用浓度还更有效。这显示,N-(正丁基)-2-吡咯烷酮即使在小的使用浓度下也可以持久地并且独立于溶液性质地促进渗透。这对于长期效果或者长期可用性(所谓的“残留效力”),尤其是对于杀真菌剂和杀昆虫剂而言是非常有利的。

[0334] 实施例19:显微法研究

[0335] 研究程序:

[0336] 制备以下溶液1)至6):

[0337] 溶液1)

[0338] 1g氯虫苯甲酰胺在1升由丙酮和蒸馏水组成的混合物中的溶液,其中丙酮:蒸馏水的重量比为30:70。

[0339] 溶液2)

[0340] 1g氯虫苯甲酰胺在1升由N-(正丁基)-2-吡咯烷酮和蒸馏水组成的混合物中的溶液,其中N-(正丁基)-2-吡咯烷酮:蒸馏水的重量比为30:70。

[0341] 溶液3)

[0342] 1g甲氨基阿维菌素苯甲酸盐在1升由丙酮和蒸馏水组成的混合物中的溶液,其中

丙酮:蒸馏水的重量比为30:70。

[0343] 溶液4)

[0344] 1g甲氨基阿维菌素苯甲酸盐在1升由N-(正丁基)-2-吡咯烷酮和蒸馏水组成的混合物中的溶液,其中N-(正丁基)-2-吡咯烷酮:蒸馏水的重量比为30:70。

[0345] 溶液5)

[0346] 1g阿维菌素在1升由丙酮和蒸馏水组成的混合物中的溶液,其中丙酮:蒸馏水的重量比为30:70。

[0347] 溶液6)

[0348] 1g阿维菌素在1升由N-(正丁基)-2-吡咯烷酮和蒸馏水组成的混合物中的溶液,其中N-(正丁基)-2-吡咯烷酮:蒸馏水的重量比为30:70。

[0349] 采用溶液1)至6)如下文所描述进行操作(参见步骤A)至C)):

[0350] A) 将各自1 $\mu$ L上述溶液1)至6)施加在硅烷化的玻璃载玻片上。

[0351] B) 将溶液在载玻片上在25℃的温度和53%相对湿度保持18小时,其中进行干燥。

[0352] C) 然后鉴定载玻片并且在液滴的原始边缘处以400倍放大拍摄照片。

[0353] 农用化学活性成分阿维菌素的照片示于附图图2A和图2B中,农用化学活性成分氯虫苯甲酰胺的照片示于附图图3A和图3B中,和农用化学活性成分甲氨基阿维菌素苯甲酸盐的照片示于附图图4A和图4B中。

[0354] 已发现,各个农用化学活性成分从丙酮与蒸馏水的混合物中结晶出来(参见图2A、图3A和图4A)并且因此不再以生物可利用的形式存在。在该结晶形式下,各个农用化学活性成分不能渗透至非植物有害生物中。

[0355] 相反地发现,各个农用化学活性成分即使在18小时之后也不从N-(正丁基)-2-吡咯烷酮与蒸馏水的混合物中结晶出来,而是另外以溶解形式存在于N-(正丁基)-2-吡咯烷酮中(参见附图图2B、图3B和图4B)。在该溶剂形式下,各个农用化学活性成分可以渗透至非植物有害生物中。

[0356]

实施例 20: 阿维菌素在 10°C 在梨中的渗透试验  
表 18: 实施例 20 的在 1 天之后和在 2 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质 (重量%), 于 10°C	活性成分	在含水喷雾液中的 阿维菌素浓度(g/l)	(+/-SE)阿维菌素在 10°C 在梨中的%渗透率 在 1 DAT 之后 // n = 5 - 7	(+/-SE)阿维菌素在 10°C 在梨中的%渗透率 在 2 DAT 之后 // n = 5 - 7
20-1	EC 18	阿维菌素	0.05	0	0.18
20-2	EC 18/NMP (0.1)	阿维菌素	0.05	0	1.26
20-3	EC 18/NMP (0.3)	阿维菌素	0.05	0	0.79
20-4	EC 18/NMP (0.5)	阿维菌素	0.05	0	1.21
20-5	EC 18/NBP (0.1)	阿维菌素	0.05	1.4	1.52
20-6	EC 18/NBP (0.3)	阿维菌素	0.05	1.2	1.64
20-7	EC 18/NBP (0.5)	阿维菌素	0.05	1.3	2.32

[0357]

实施例 21： 采用氯虫苯甲酰胺在 10°C 在梨中的渗透试验

表 19： 实施例 21 的在 1 天之后和在 2 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质 (重量%), 于 10°C	活性成分	在含水喷雾液中的 氯虫苯甲酰胺浓度(g/l)	(+/-SE)氯虫苯甲酰胺在 10°C 在梨中的%渗透率 在 6 h 之后 // n = 5 - 7	(+/-SE)氯虫苯甲酰胺在 10°C 在梨中的%渗透率 在 2 DAT 之后 // n = 5 - 7
21-1	SC 200	氯虫苯甲酰胺	0.1	1.17	1.36
21-2	SC 200/NMP (0.1)	氯虫苯甲酰胺	0.1	0.98	1.1
21-3	SC 200/NMP (0.5)	氯虫苯甲酰胺	0.1	1.06	1.25
21-4	SC 200/DMSO (0.1)	氯虫苯甲酰胺	0.1	0.98	1.11
21-5	SC 200/DMSO (0.5)	氯虫苯甲酰胺	0.1	1.05	1.14
21-6	SC 200/Galaster BL 97 (0.1)	氯虫苯甲酰胺	0.1	1.42	1.47
21-7	SC 200/Galaster BL 97 (0.5)	氯虫苯甲酰胺	0.1	1.33	1.26
21-8	SC 200/异佛尔酮 (0.1)	氯虫苯甲酰胺	0.1	1.1	1.15
21-9	SC 200/异佛尔酮 (0.5)	氯虫苯甲酰胺	0.1	1.14	1.53
21-10	SC 200/NBP (0.1)	氯虫苯甲酰胺	0.1	1.34.	2.35
21-11	SC 200/NBP (0.3)	氯虫苯甲酰胺	0.1	6.71	11.53
21-12	SC 200/NBP (0.5)	氯虫苯甲酰胺	0.1	6.04	10.41

[0358]

实施例 22: 采用氯吡脞在 10°C 在梨中的渗透试验

表 20: 实施例 22 的在 6 h、1 天之后和在 3 天之后的渗透率结果

实施例	在含水喷雾液中的 制剂/测试物质 (重量%), 于 10°C	活性成分	在含水喷雾液中的 氯吡脞浓度(g/l)	(+/-SE)氯吡脞在 10°C 在梨中的%渗透率 在 6 h 之后 // n = 5 - 7	(+/-SE)氯吡脞在 10°C 在梨中的%渗透率 在 1 DAT 之后 // n = 5 - 7	(+/-SE)氯吡脞在 10°C 在梨中的%渗透率 在 3 DAT 之后 // n = 5 - 7
22-1	受体介质	氯吡脞	0.03	2.98	8.22	12.77
22-2	受体介质/NBP (0.01)	氯吡脞	0.03	9.67	23.2	33.79
22-3	受体介质/NBP (0.05)	氯吡脞	0.03	21	40.88	53.39

表 20 中的结果证实, 可以采用非常小的活性成分含量(在此为 0.03 g/L 氯吡脞)和非常小的 NBP 含量制备高效的喷雾液。

[0359]

实施例 23: 具有丙硫菌唑的制剂

制备具有活性成分丙硫菌唑与各种添加物组合的制剂。单个制剂的组成由下表 21 表明。显示了活性成分在所有制剂中以高浓度溶解而存在。

表 21

成分	实施例 23-1	实施例 23-2	实施例 23-3	实施例 23-4	实施例 23-5	实施例 23-6	实施例 23-7	实施例 23-8
丙硫菌唑(98.5% RW) [g]							28.88	28.88
丙硫菌唑(98% RW) [g]			25.26	25.26	25.26			
丙硫菌唑(96% RW) [g]	20.19	25.94				30.9		
Genagen NBP (原样) [g]	65.51	15	21	44.74	27.49	34.07	32.17	32.11
Genagen PA (原样) [g]		7.5			14.7		1.5	
MSO (原样) [g]								15
Genagen 4296 (原样) [g]								1.5
Agsolex 08 (原样) [g]			26.24			20		
Solvesso 200 ND (原样) [g]		31.56						
菜籽油 甲酯和菜籽油 乙酯(原样) [g]			12.5		15			
菜籽油 乙酯[g]							15	
Emulsogen 3510 (原样) [g]	5							5

[0360]

Synergen 848 (原样) [g]					10	5		5	
Synergen W03 (原样) [g]		5							
Synergen W09 (原样) [g]	6.8								
Genapol X 090 (原样) [g]	2.5	4.5							
Emulsogen MTP 070 (原样) [g]					20				
Emulsogen EL 300 (原样) [g]		10.5							
Emulsogen EL 360 (原样) [g]			15			12.5	15	17.5	17.5
Momentive SAG 1571 (原样) [g]						0.05	0.03	0.01	0.01
总计[g]	100	100	100	100	100	100	100	100	100
类型 <sup>1)</sup>	200 EC	250 EC	250 EC	250 EC	250 EC	250 EC	300 EC	300 DC	300 DC

1) X EC = 具有 x g/l 活性成分浓度的乳液浓缩物; X DC = 具有 x g/l 活性成分浓度的分散体浓缩物

[0361] 在表21中显示,使用式I的N-取代的吡咯烷酮可以制备高度浓缩的活性成分制剂。所制备的制剂是稳定的并且满足关于可乳化性和可分散性的常规FAO测试。所制备的制剂



例如在0°和54℃在两周储存的情况下也是稳定的,可再分散的并且可以没有问题地与其它物质一起混入喷洒液中。

[0362] 300g/l的高活性成分负载量可以在乳液浓缩物中以及在分散体浓缩物中得以实现。

[0363] 在表21中另外显示,式I的N-取代的吡咯烷酮可以单独作为溶剂使用(实施例23-1)或与其它溶剂组合使用。

[0364] 在表21中描述的制剂显示了高的吸收速率(渗透),其比市售产品更高。

[0365] 在市售产品的情况下,经常使用N,N-二甲基癸酰胺作为渗透促进剂。在表21中显示,该化合物可以以相对低的浓度作为溶剂和/或作为结晶抑制剂与根据本发明使用的式I的N-取代的吡咯烷酮组合作为渗透促进剂用于具有非常高的渗透效果的活性成分制剂。

[0366] 实施例24:具有抗倒酯或阿维菌素和啉虫脒的制剂

[0367] 制备具有活性成分抗倒酯或者具有阿维菌素和啉虫脒与各种添加物组合的制剂。单个制剂的组成由下表22表明。显示了活性成分在所有制剂中以高浓度溶解而存在。

[0368] 表22

成分	实施例 24-1	实施例 24-2	实施例 24-3	实施例 24-4
抗倒酯 (97.1% RW) [g]	19.44	19.51	25.84	
阿维菌素 (95% RW) [g]				2.1
啉虫脒 (95% RW) [g]				10.5
Genagen NBP (原样) [g]	9.69	12.49	12.94	50.4
Hostaphat 1306 (原样) [g]	24.42	26.55		
Synergen 848 (原样) [g]	5	5		
[0369] Synergen W03 (原样) [g]				10
Emulsogen MTP 070 (原样) [g]	29.02	31.5		
Emulsogen ELO 200 (原样) [g]			10	7
Synergen SOC (原样) [g]			51.22	
三乙醇胺 (原样) [g]	7.43	4.95		
MSO (原样) [g]				10
水(原样) [g]	5			
总计[g]	100	100	100	100
类型 <sup>1)</sup>	200 EW	200 DC	250 EC	120 EC

[0370] 1) X EC=具有x g/l活性成分浓度的乳液浓缩物;X DC=具有x g/l活性成分浓度的分散体浓缩物;X EW=具有x g/l活性成分浓度的水包油乳液

[0371] 在表22中显示,使用式I的N-取代的吡咯烷酮可以制备其它高度浓缩的活性成分

制剂。所制备的制剂是稳定的并且满足关于可乳化性和可分散性的常规FAO测试。所制备的制剂例如在0°和54℃在两周储存的情况下也是稳定的,可再分散的并且可以没有问题地与其它物质一起混入喷洒液中。

[0372] 表22中描述的制剂显示了高的吸收速率(渗透)。

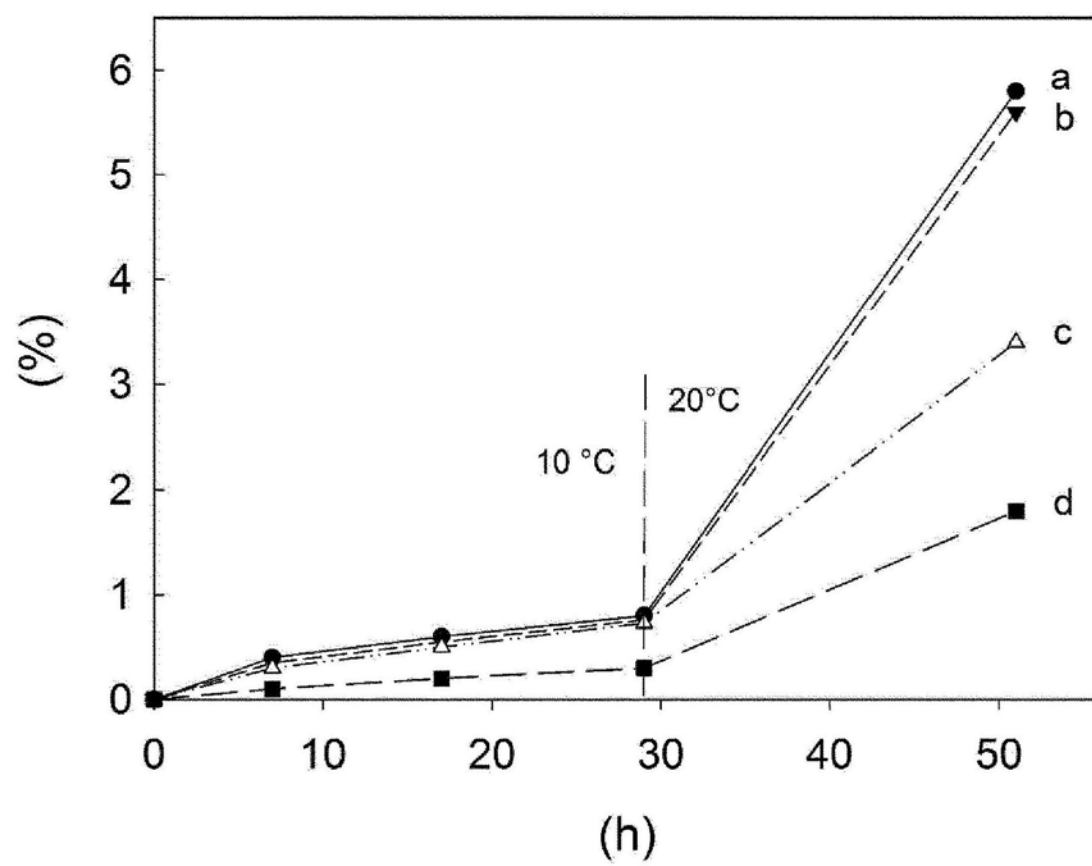


图1

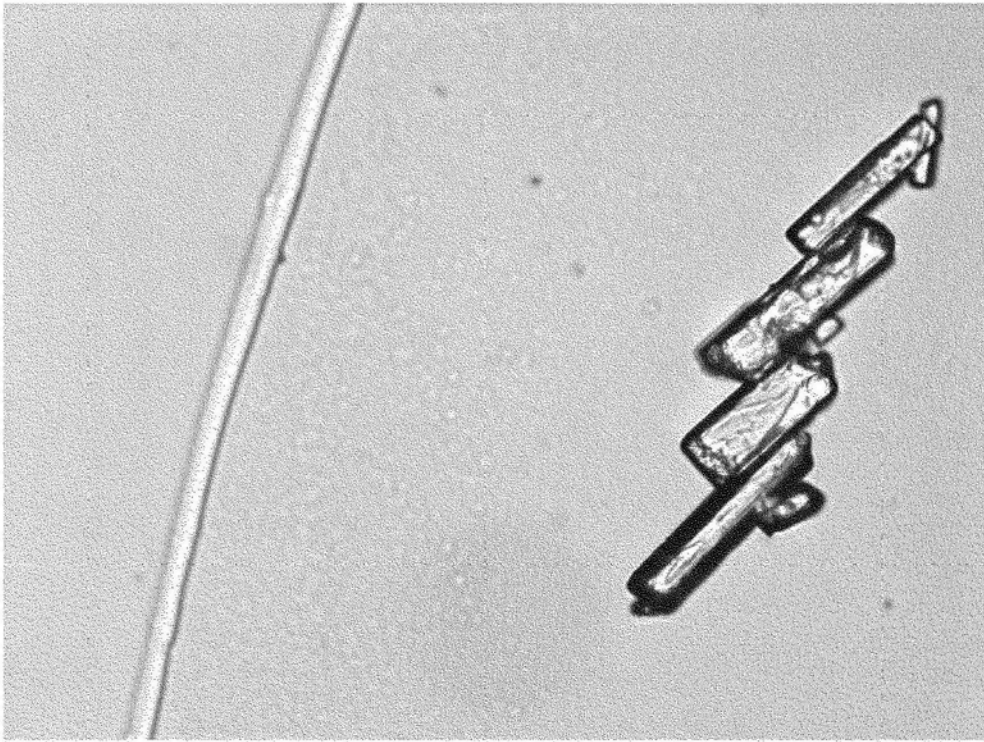


图2A

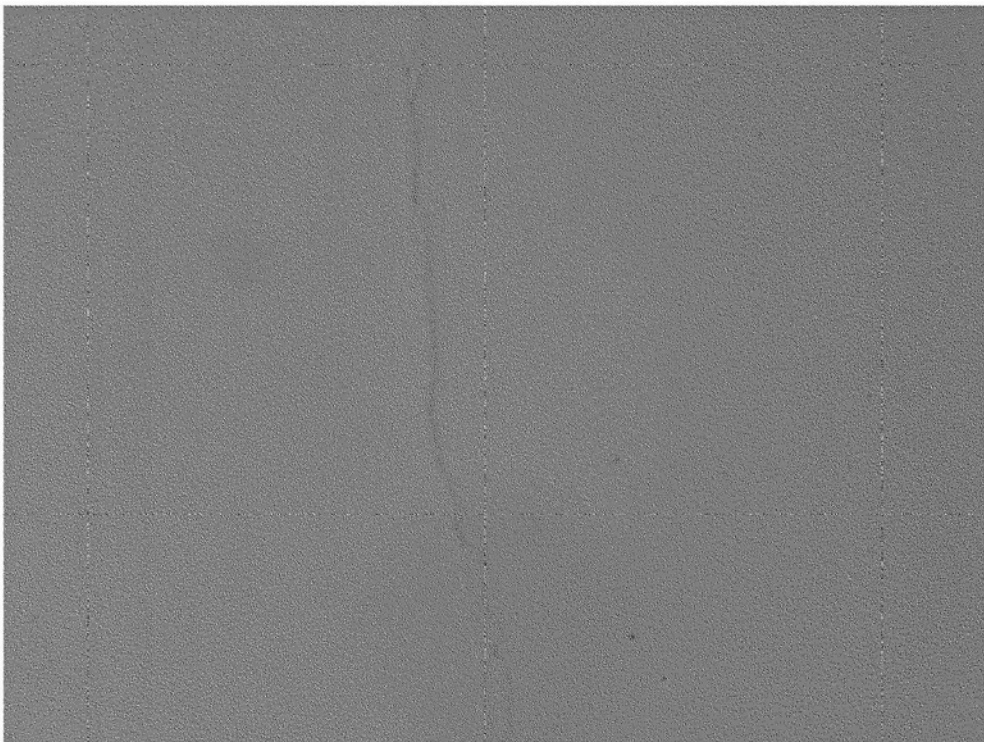


图2B

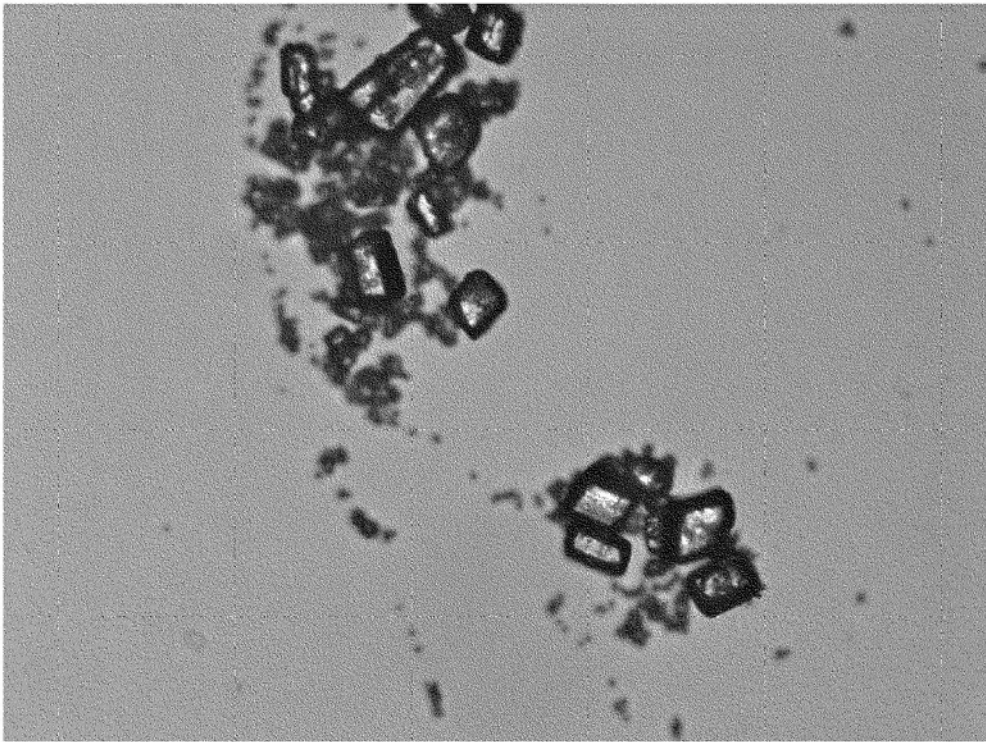


图3A

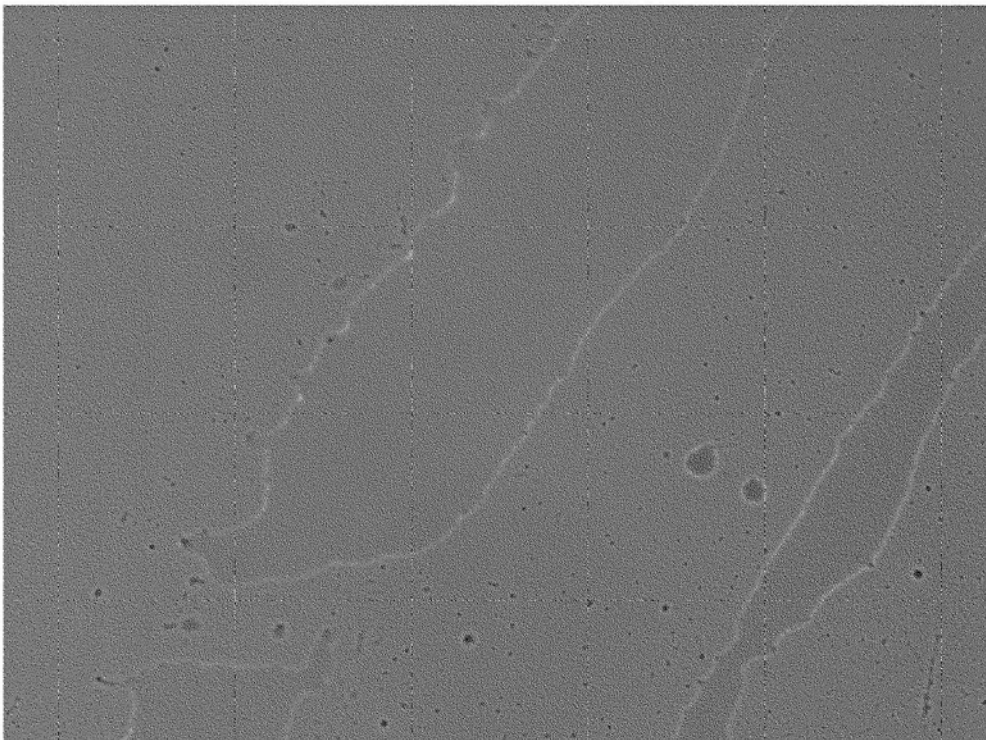


图3B

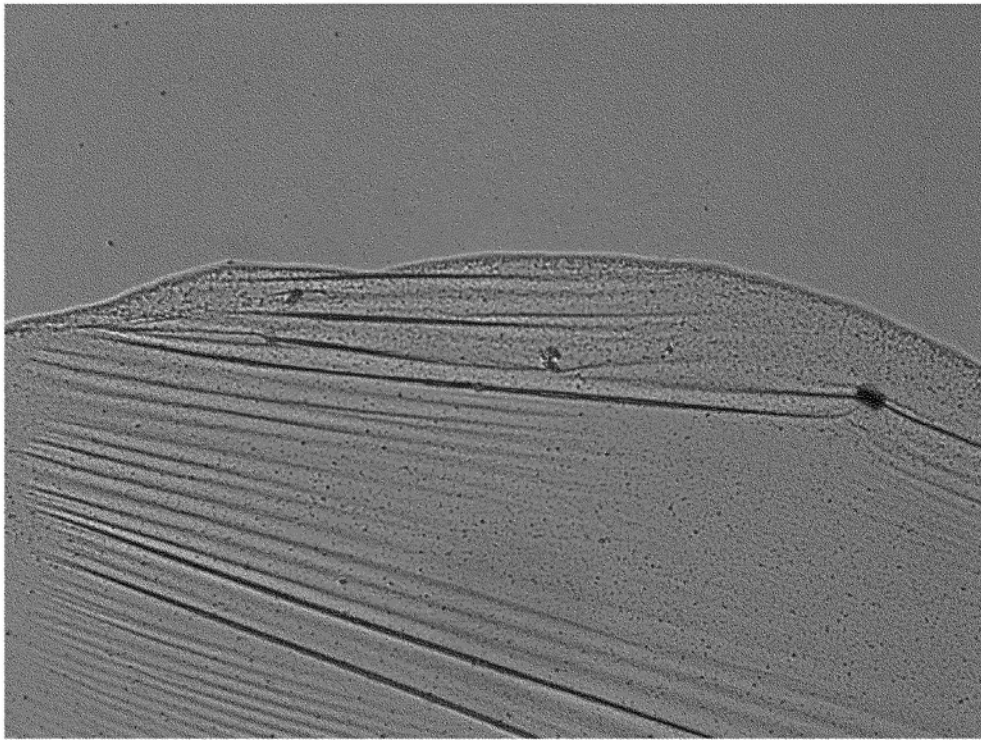


图4A

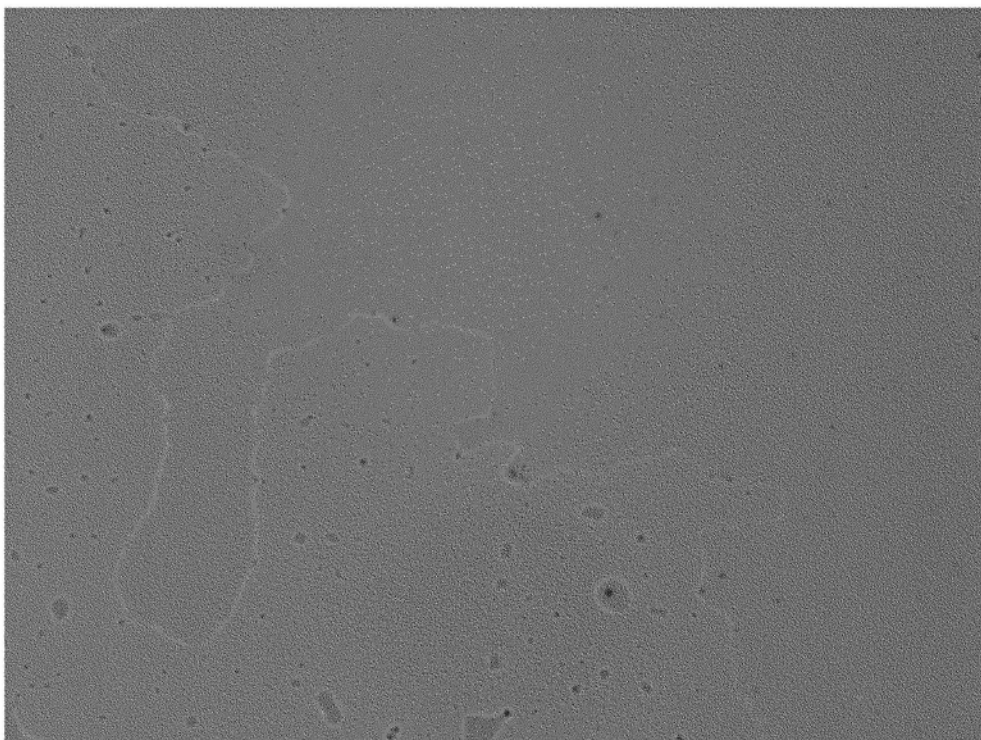


图4B