

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

A01N 43/22

/(A01N43/22 51: 00 47: 40)

[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 99809052.2

[43] 公开日 2001 年 9 月 5 日

[11] 公开号 CN 1311632A

[22] 申请日 1999.5.17 [21] 申请号 99809052.2

[30] 优先权

[32] 1998.5.26 [33] DE [31] 19823396.5

[86] 国际申请 PCT/EP99/03394 1999.5.17

[87] 国际公布 WO99/60857 德 1999.12.2

[85] 进入国家阶段日期 2001.1.22

[71] 申请人 拜尔公司

地址 德国莱沃库森

[72] 发明人 W·安施德 H·-J·施诺巴赫

D·沃尔韦伯

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 王景朝 邵红

权利要求书 2 页 说明书 36 页 附图页数 0 页

[54] 发明名称 增效杀虫混合物

[57] 摘要

本发明涉及用于保护农作物不受害虫侵害的由 spinosyns 和烟碱的乙酰胆碱受体的激动剂或拮抗剂组成的杀虫混合物。

I S S N 1 0 0 8 - 4 2 7 4

权 利 要 求 书

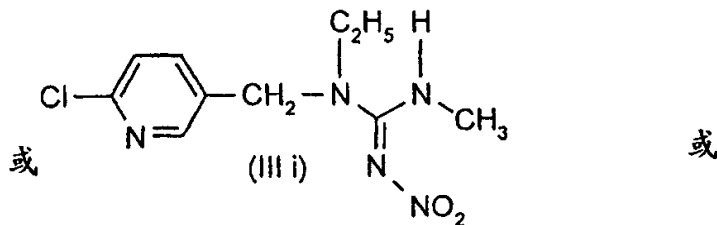
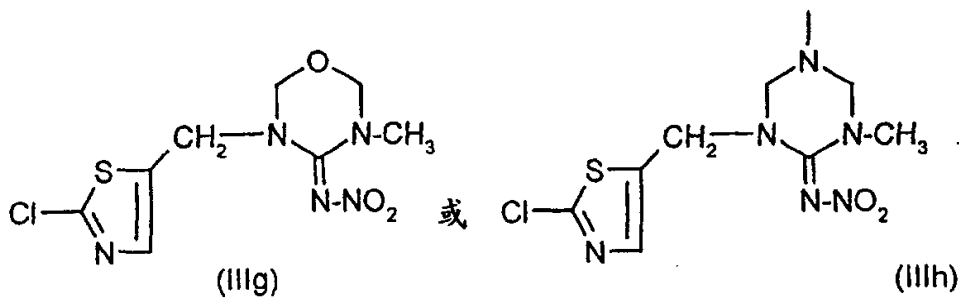
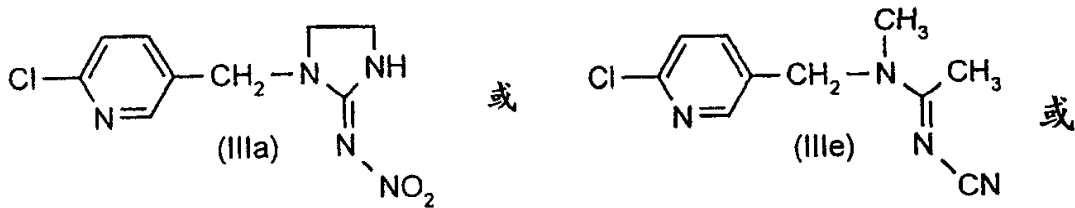
1. 防治动物害虫的组合物, 包含一种含一种或多种 spinosyns 和至少一种烟碱的乙酰胆碱受体的激动剂或拮抗剂的增效混合物。

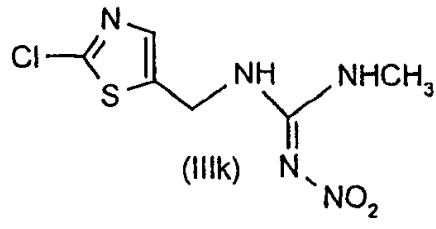
5 2. 根据权利要求 1 的组合物, 包含 1:100 至 100:1 比例的 spinosyns 和烟碱的乙酰胆碱受体的激动剂或拮抗剂。

3. spinosyns 和至少一种烟碱的乙酰胆碱受体的激动剂或拮抗剂的增效混合物防治动物害虫的用途。

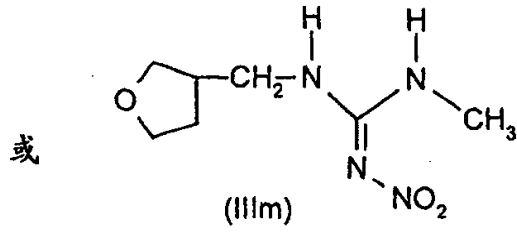
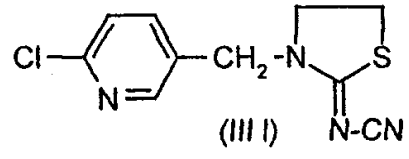
10 4. 制备农药的方法, 特征在于将 spinosyns 和至少一种烟碱的乙酰胆碱受体的激动剂或拮抗剂的增效混合物与扩充剂和/或表面活性剂混合。

5. 根据权利要求 1 或 2 的混合物, 包括至少一种下面的化合物





或



说 明 书

增效杀虫混合物

5 本发明涉及一种或多种 spinosyns 和烟碱的 (nicotinic) 乙酰胆碱受体的激动剂或拮抗剂的增效杀虫混合物, 并且涉及它们防治动物害虫的用途。

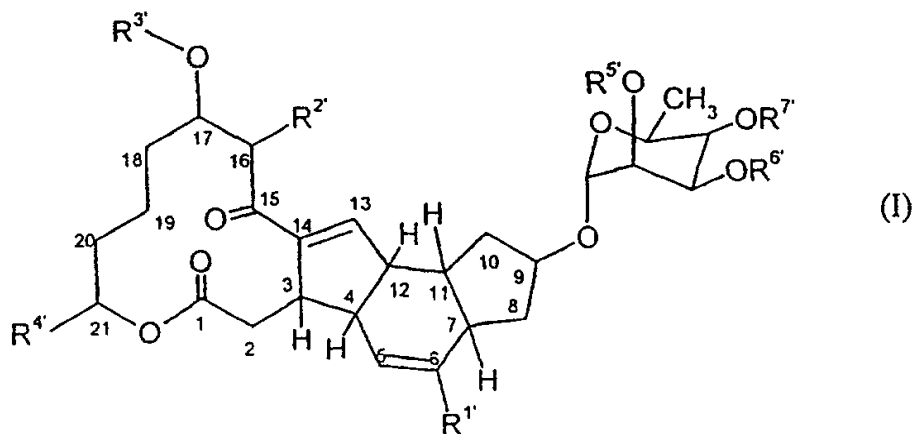
spinosyns 可以用于防治昆虫这一点已经是公知的 (W097/00265, W093/09126, W094/20518, US-5362634, US-5202242, US-5670364, US5227295, 也参见 DowElanco trade magazine Down to
10 Earth, Vol. 52, No. 1, 1997)。

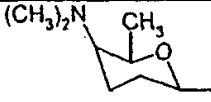
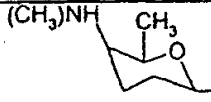
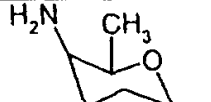
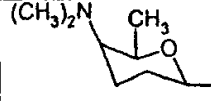
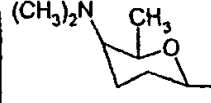
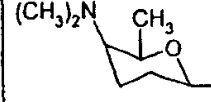
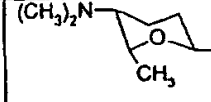
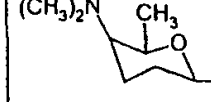
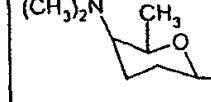
但是 spinosyns 自身并不总是表现出令人满意的杀虫活性。

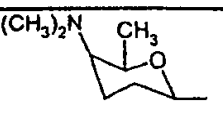
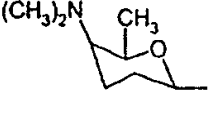
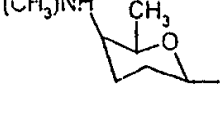
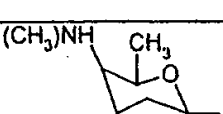
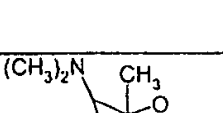
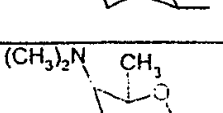
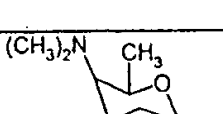
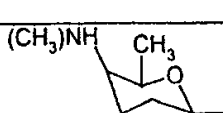
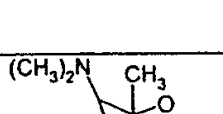
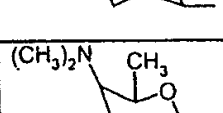
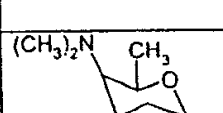
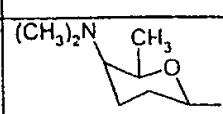
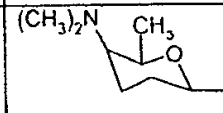
此外, 已知烟碱的乙酰胆碱受体的激动剂和拮抗剂可以用于防治昆虫。

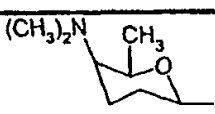
15 现在发现 spinosyns 和至少一种式 (III) 的乙酰胆碱受体的激动剂或拮抗剂的混合物具有增效效果并且适于防治动物害虫。由于该增效作用, 有可能使用相当低的活性化合物的量, 即混合物的活性大于各成分的活性。

spinosyns 是已知的化合物。US5362634 中描述的发醇产物 (A83543) 包括称之为 spinosyns A, B, C 等的各种化合物 (参见
20 W097/00265, W093/09126 和 W094/20518)。spinosyns 可以用下面的式 (I) 和 (II) 表示。

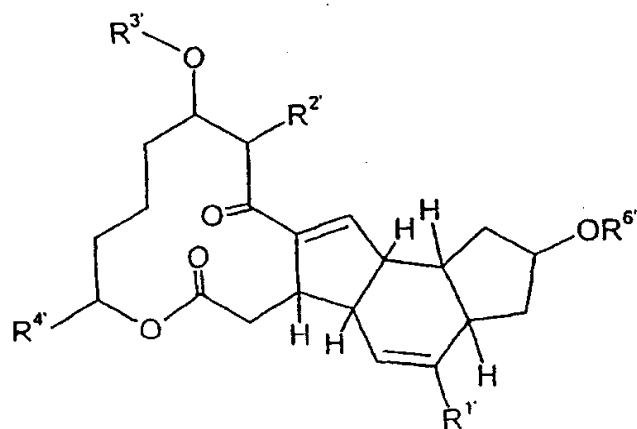


化合物	R ^{1'}	R ^{2'}	R ^{3'}	R ^{4'}	R ^{5'}	R ^{6'}	R ^{7'}
Spinosyn A	H	CH ₃		C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃
Spinosyn B	H	CH ₃		C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃
Spinosyn C	H	CH ₃		C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃
Spinosyn D	CH ₃	CH ₃		C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃
Spinosyn E	H	CH ₃		CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
Spinosyn F	H	H		C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃
Spinosyn G	H	CH ₃		C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃
Spinosyn H	H	CH ₃		C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃
Spinosyn J	H	CH ₃		C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃

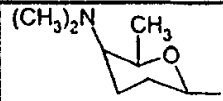
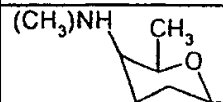
化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷
Spinosyn K	H	CH ₃		C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H
Spinosyn L	CH ₃	CH ₃		C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃
Spinosyn M	H	CH ₃		C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃
Spinosyn N	CH ₃	CH ₃		C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃
Spinosyn O	CH ₃	CH ₃		C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H
Spinosyn P	H	CH ₃		C ₂ H ₅	CH ₃	H	H
Spinosyn Q	CH ₃	CH ₃		C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃
Spinosyn R	H	CH ₃		C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃
Spinosyn S	H	CH ₃		CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
Spinosyn T	H	CH ₃		C ₂ H ₅	H	H	CH ₃
Spinosyn U	H	CH ₃		C ₂ H ₅	H	CH ₃	H
Spinosyn V	CH ₃	CH ₃		C ₂ H ₅	H	CH ₃	H
Spinosyn W	CH ₃	CH ₃		C ₂ H ₅	CH ₃	H	H

化合物	R ^{1'}	R ^{2'}	R ^{3'}	R ^{4'}	R ^{5'}	R ^{6'}	R ^{7'}
Spinosyn Y	H	CH ₃		C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H
Spinosyn A 17-Psa	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃
Spinosyn D 17-Psa	CH ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃
Spinosyn E 17-Psa	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃
Spinosyn F 17-Psa	H	H	H	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃
Spinosyn H 17-Psa	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃
Spinosyn J 17-Psa	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃
Spinosyn L 17-Psa	CH ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃

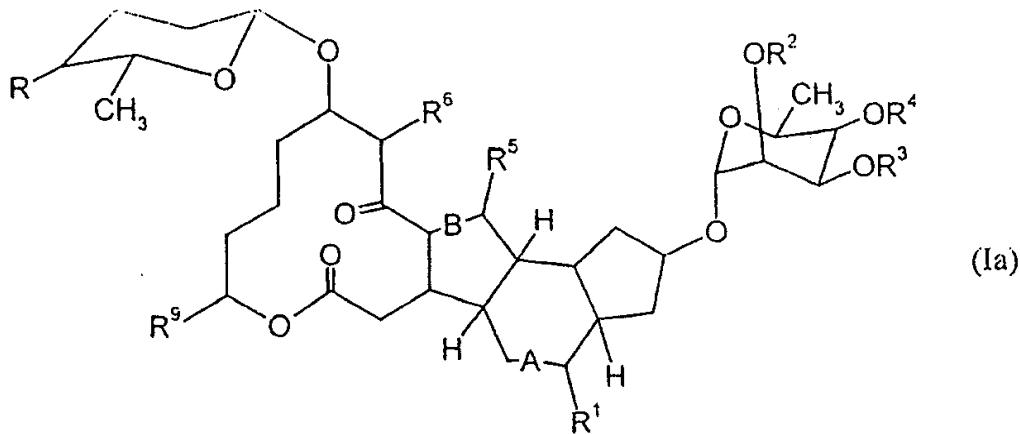
和



(II)

化合物	R ^{1'}	R ^{2'}	R ^{3'}	R ^{4'}	R ^{5'}
Spinosyn A 9-Psa	H	CH ₃		C ₂ H ₅	H
Spinosyn D 9-Psa	CH ₃	CH ₃		C ₂ H ₅	H
Spinosyn A Aglycone	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H
Spinosyn D Aglycone	CH ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H

式 (Ia) 的半合成 spinosyns 也是已知的 (W097/00265)



5

其中

A 和 B 各自代表单键, 双键或环氧单元,

R 代表 $\begin{matrix} R^7 \\ \diagdown \\ N \\ \diagup \\ R^8 \end{matrix}$ 或 R^{8'}-O,

R¹ 代表氢或甲基,

10 R², R³ 和 R⁴ 各自独立地代表 C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-卤代烷基, C₁-C₄-烷基羧基或保护的羟基,

R⁵ 代表氢, C₁-C₄-烷基, C₁-C₄-烷基氨基或者代表式 $\begin{matrix} -N-OR^{11} \\ | \\ OR^{10} \end{matrix}$ 的烷基

羟基氨基, 其中

R^{10} 和 R^{11} 各自独立地代表氢, C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_5 -烷基羰基,

R^6 代表氢或甲基,

R^7 , R^8 和 R^9 各自独立地代表 C_1-C_4 -烷基, C_1-C_4 -卤代烷基或 C_1-C_4 -烷基羰基或代表保护的氨基, 和

5 R^9 代表甲基或乙基。

WO97/00265 中公开的化合物明确地并入本申请作为参考。

本发明的混合物包含至少一种式 (I), (Ia) 或 (II) 的 spinosyn.

10 优选的是包含至少一种式 (I) 或 (II) 的 spinosyn 的增效混合物。

特别优选的是包含 spinosyn A 和 spinosyn D 的混合物的增效混合物, 其中 spinosyn A 与 spinosyn D 的比例一般在大约 80:20 和大约 98:2 之间, 并且优选大约 85:15 的值。

15 非常特别优选的是使用 Spinosad (参见例如 DowElanco trade magazine Down to Earth, Vol. 52, No. 1, 1997 及其引用文献), 其主要由 spinosyn A 和 spinosyn D 以大约 85:15 的比例的混合物组成。

特别是使用 US-5362634 公开的发酵产物 A83543, 其包括大约 85-90% 的 spinosyn A, 大约 10-15% 的 spinosyn D 和少量的 spinosyns B, C, E, F, G, H 和 J.

20 也可以使用其中描述的酸加成盐。

烟碱的乙酰胆碱受体的激动剂和拮抗剂是已知的化合物, 其从下面的公开物得知:

欧洲公开说明书 Nos. 464 830, 428 941, 425 978, 386 565,

383 091, 375 907, 364 844, 315 826, 259 738, 254 859, 235 725, 212 600, 192 060, 163 855, 154 178, 136 636, 136 686, 303 570, 302 833, 306 696, 189 972, 455 000, 135 956, 471 372, 302 389, 428 941, 376 279, 493 369, 580 553, 649 845, 685 477, 483 055, 580 553;

25

德国公开说明书 Nos. 3 639 877, 3 712 307;

日本公开说明书 Nos. 03 220 176, 02 207 083, 63 307 857,
63 287 764, 03 246 283, 04 9371, 03 279 359, 03 255 072, 05 178 833, 07 173 157,
08 291 171;

美国专利 Nos. 5034524, 4948798, 4918086, 5039686, 5034404,
5532365, 4849432;

5 PCT 申请 Nos. W091/17659, 91/4965;

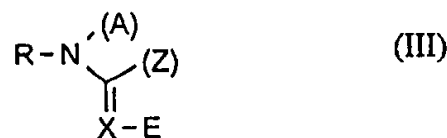
法国申请 No. 2611114;

巴西申请 No. 8803621.

10 这些公开物中描述的所有通式和定义, 以及其中描述的各化合物
明确地引入本申请作为参考。

这些化合物中的一些概括称之为硝基亚甲基类, 硝基亚胺类和相
关的化合物。

优选地, 这些化合物可以用式 (III) 概括



15

其中

R 代表氢或者代表任选被取代的选自酰基, 烷基, 芳基, 芳烷基, 杂环基,
杂芳基和杂芳基烷基的基团;

20 A 代表选自氢, 酰基, 烷基, 芳基的单官能基团或者代表与基团 Z 键连
的双官能基团;

E 代表吸电子基团;

X 代表基团 -CH= 或 =N-, 其中基团 -CH= 可以代替 H 原子而与基团 Z 键
连;

Z 代表选自下面的单官能基团: 烷基, $-O-R$, $-S-R$, $-N \begin{matrix} R \\ R \end{matrix}$,

其中基团 R 是相同或不同的并且如上定义,
或者代表与基团 A 或基团 X 键连的双官能基团。

5 特别优选式 (III) 的化合物, 其中各基团具有下面的定义:

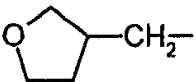
R 代表氢和代表任选被取代的选自酰基, 烷基, 芳基, 芳烷基, 杂环烷基, 杂芳基, 杂芳基烷基的基团。

酰基的例子是甲酰基, 烷基羰基, 芳基羰基, 烷基磺酰基, 芳基磺酰基, (烷基-)-(芳基-)-磷酰基, 其本身可以被取代。

10 烷基的例子是 C_1-C_{10} -烷基, 特别是 C_1-C_4 -烷基, 具体是甲基, 乙基, 异丙基, 仲-或叔-丁基, 其本身可以被取代。

芳基的例子是苯基, 萘基, 特别是苯基。

芳烷基的例子是苯甲基, 苯乙基。

杂环烷基的例子是基团 

15 杂芳基的例子是具有至多 10 个环原子和 N、O、S, 特别是 N 作为杂原子的杂芳基。具体的例子是噻吩基, 呋喃基, 噻唑基, 咪唑基, 吡啶基, 苯并噻唑基, 吡嗪基。

杂芳基烷基的例子是具有至多 6 个环原子和 N、O、S, 特别是 N 作为杂原子的杂芳基甲基, 杂芳基乙基, 特别是如对杂芳基定义的任
20 选被取代的杂芳基。

作为例子和作为优选可以提到的取代基是:

25 优选具有 1-4 个、特别是 1 或 2 个碳原子的烷基, 例如甲基, 乙基, 正-和异-丙基和正-, 异-和叔-丁基; 优选具有 1-4 个、特别是 1 或 2 个碳原子的烷氧基, 例如甲氧基, 乙氧基, 正-和异-丙氧基和正-, 异-和叔-丁氧基; 优选具有 1-4 个、特别是 1 或 2 个碳原子的烷硫基, 例如甲硫基, 乙硫基, 正-和异-丙硫基和正-, 异-和叔-丁硫基; 优选具有 1-4 个、特别是 1 或 2 个碳原子和优选地具有 1-5 个、特别是 1-3 个卤原子的卤代烷基, 其中所述卤原子是相同或不同的, 优选的卤原子是氟,

氯或溴,特别是氟,例如三氟甲基;羟基;卤素,优选氟,氯,溴和碘,特别是氟,氯和溴;氰基;硝基;氨基;每个烷基优选具有1-4个、特别是1或2个碳原子的一烷基-和二烷基氨基,例如甲基氨基,甲基乙基氨基,正-和异-丙基氨基和甲基正丁基氨基;羧基;优选具有2-4个、特别是

5 2或3个碳原子的烷氧羰基,例如甲氧羰基和乙氧羰基;磺基(SO₃H);优选具有1-4个、特别是1或2个碳原子的烷基磺酰基,例如甲基磺酰基和乙基磺酰基;优选具有6或10个芳基碳原子的芳基磺酰基,例如苯基磺酰基;以及杂芳基氨基和杂芳基烷基氨基,例如嘧啶基氨基和嘧啶基甲基氨基。

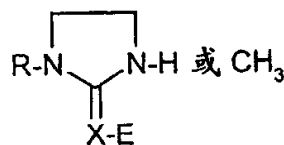
10 A代表氢或者代表任选被取代的优选如对于R定义的选自酰基,烷基,芳基的基团,A还代表双官能基团。例子包括具有1-4个、特别是1或2个碳原子的任选被取代的亚烷基,其中取代基的例子是上文已经提到的取代基(并且其中亚烷基可以插入选自N,O,S的杂原子)。

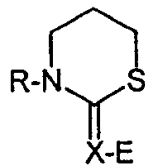
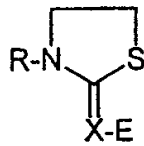
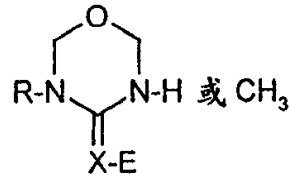
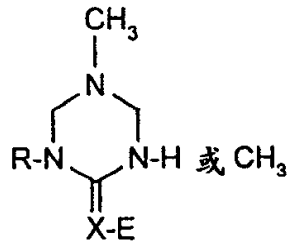
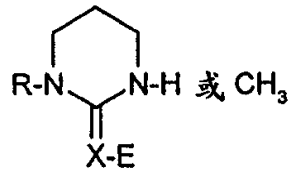
A和Z与它们所连接的原子一起可以形成饱和的或不饱和的杂环。该

15 杂环可以含有另外1个或2个相同或不同的杂原子和/或杂基。优选的杂原子是氧,硫或氮,优选的杂基是N-烷基,其中N-烷基中的烷基优选含有1-4个、特别是1或2个碳原子。烷基的例子包括甲基,乙基,正-和异-丙基和正-,异-和叔-丁基。杂环含有5-7个,优选5或6个环原子。

20

其中R和Z与它们所连接的原子一起形成一个环的式(III)的化合物的例子包括如下:





其中

E, R 和 X 各自如上和如下定义。

5

E 代表吸电子基团, 其中尤其是 NO_2 , CN , 卤代烷基羰基如卤代- C_1 - C_4 -烷基羰基, 例如 COCF_3 , 烷基磺酰基 (例如 $\text{SO}_2\text{-CH}_3$), 卤代烷基磺酰基 (例如 SO_2CF_3), 特别优选 NO_2 或 CN 。

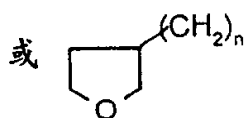
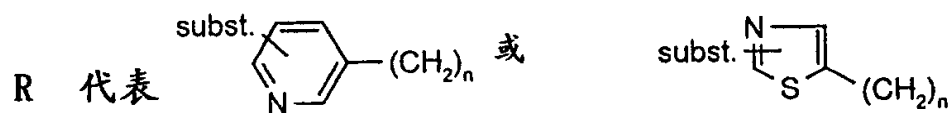
X 代表 $-\text{CH}=\text{}$ 或 $-\text{N}=\text{}$ 。

10 Z 代表任选被取代的选自烷基, $-\text{OR}$, $-\text{SR}$, $-\text{NRR}$ 的基团, 其中 R 和取代基优选如上定义。

Z 除上述环之外可以与它们连接的原子和代替 X 的 $\text{=C}^{\text{I}}\text{-}$ 一起形成饱和的或不饱和的杂环。该杂环可以含有另外 1 个或 2 个相同或不同的杂原子和/或杂基。优选的杂原子是氧, 硫或氮, 优选的杂基是 N-烷基, 其中 N-烷基中的烷基优选含有 1-4 个、特别是 1 或 2 个碳原子。

- 5 烷基的例子包括甲基, 乙基, 正-和异-丙基以及正-, 异-和叔-丁基。所述杂环含有 5-7 个、优选 5 或 6 个环原子。杂环的例子包括吡咯烷, 哌啶, 哌嗪, 六亚甲基亚胺, 吗啉和 N-甲基哌嗪。

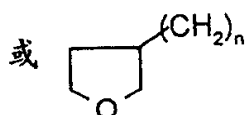
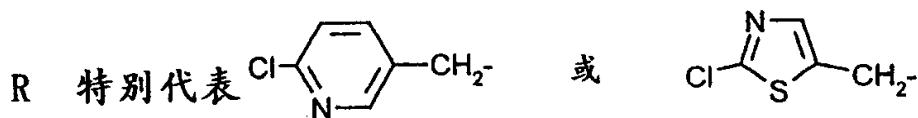
烟碱的乙酰胆碱受体的激动剂和拮抗剂特别优选是式 (III) 的化合物, 其中



其中

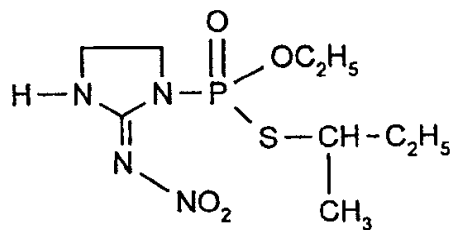
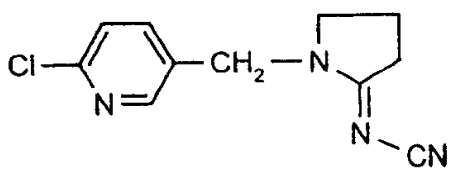
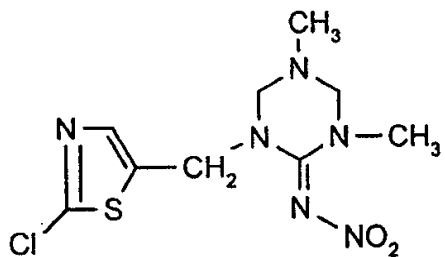
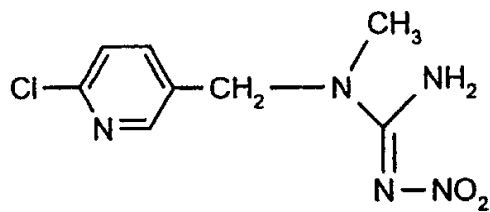
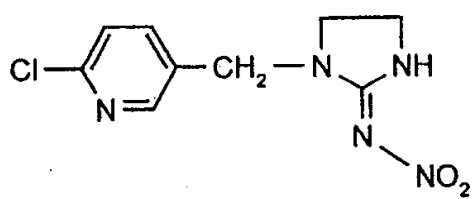
- 15 n 代表 0, 1 或 2, 优选代表 1,

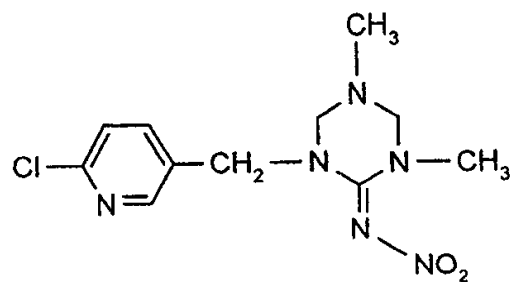
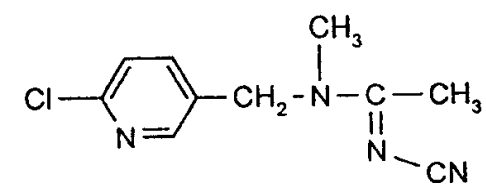
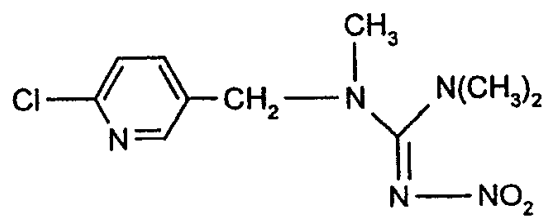
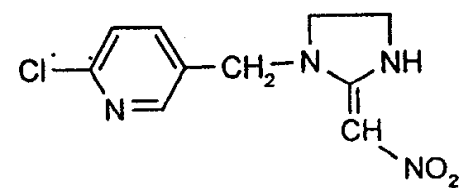
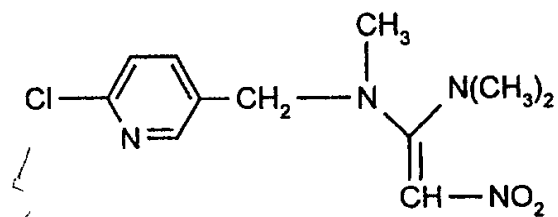
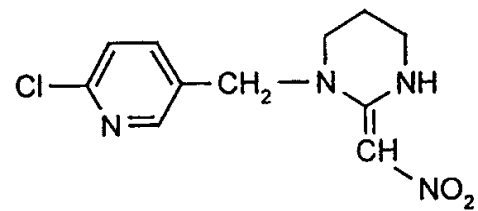
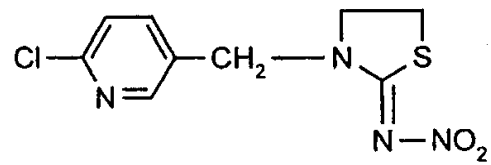
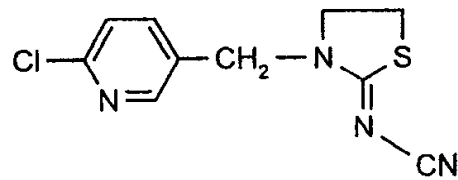
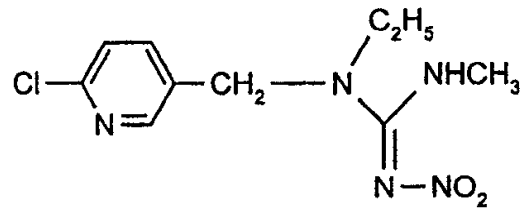
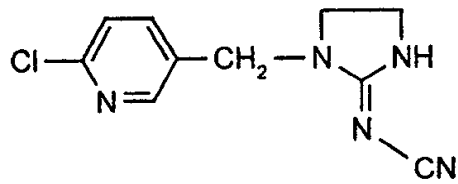
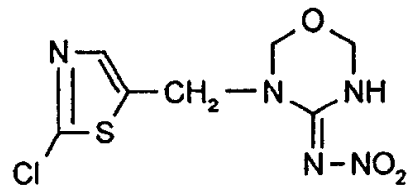
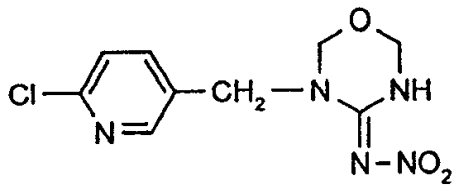
subst. 代表上述取代基之一, 特别是卤素, 尤其是氯, 并且 A, Z, X 和 E 如上定义。

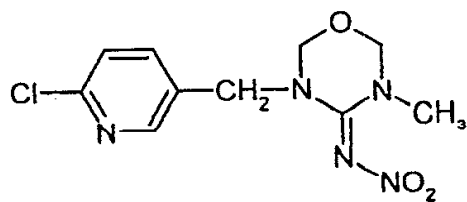
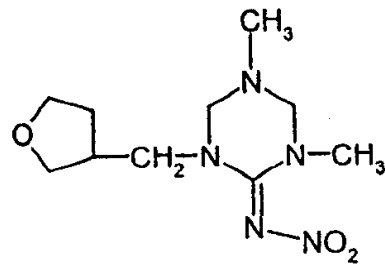
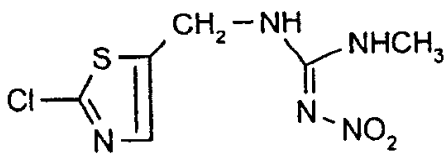
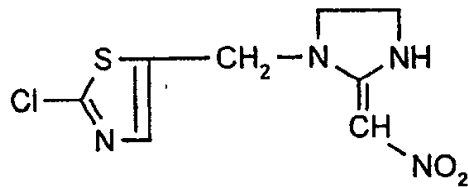
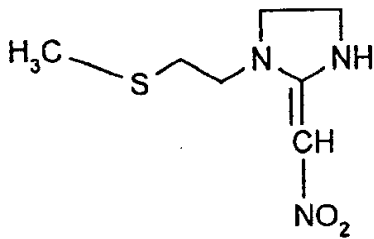
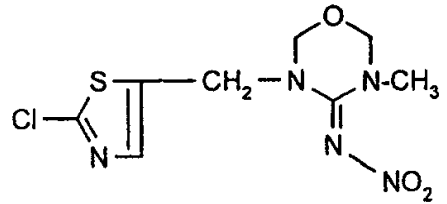
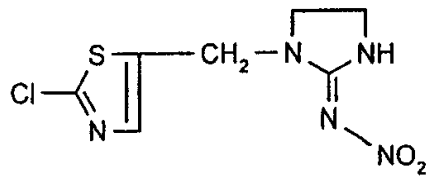
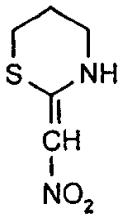
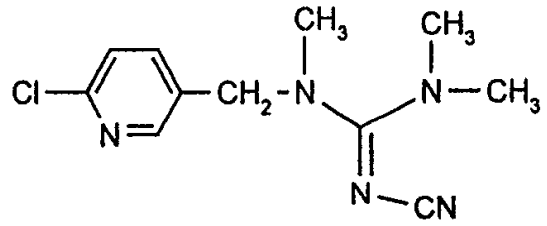
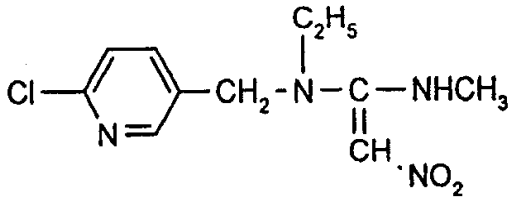
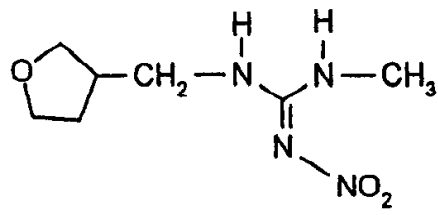
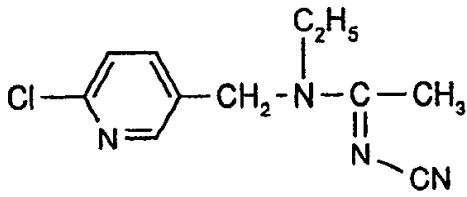


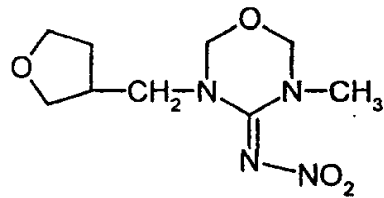
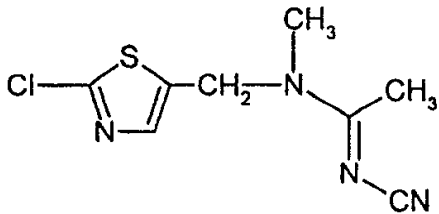
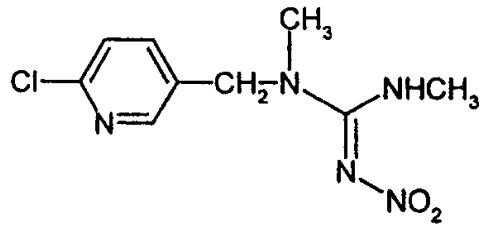
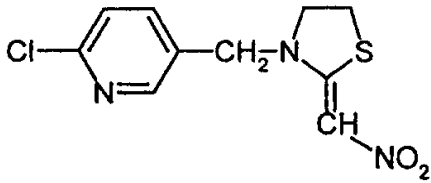
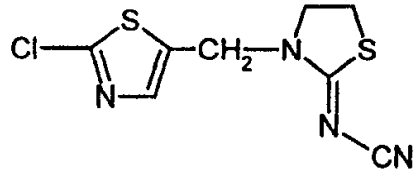
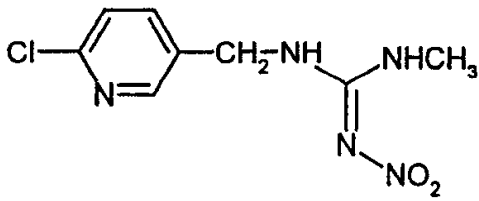
- 20 下面的化合物是具体的例子:

010192



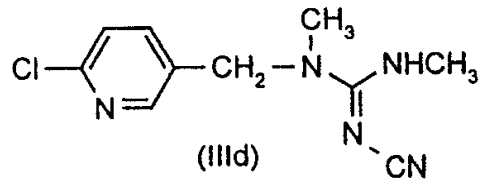
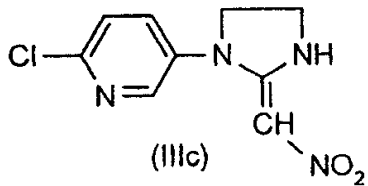
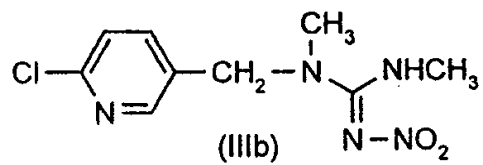
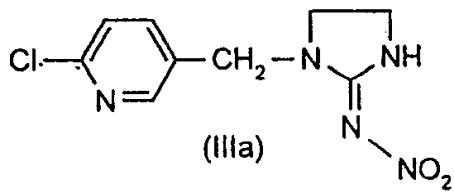


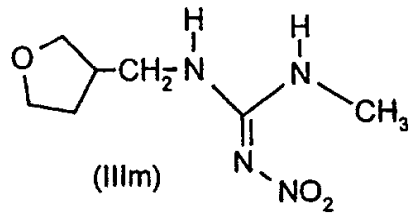
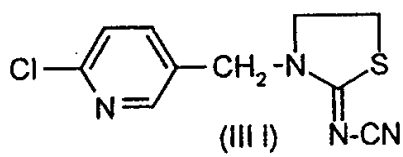
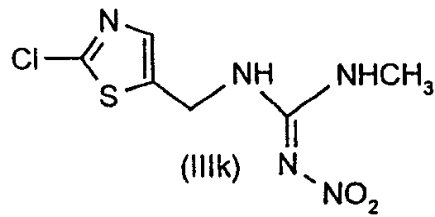
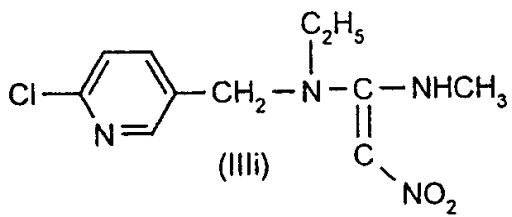
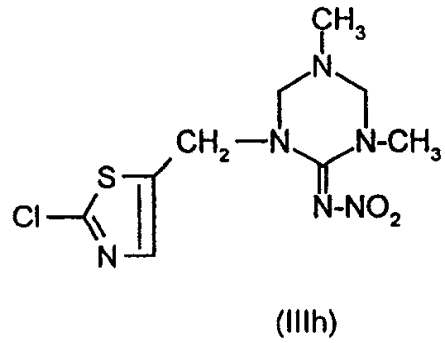
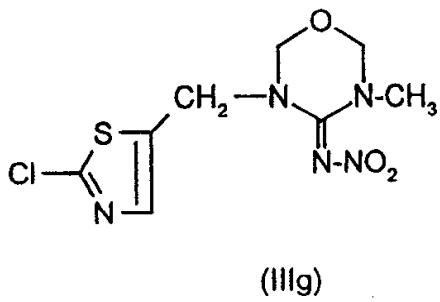
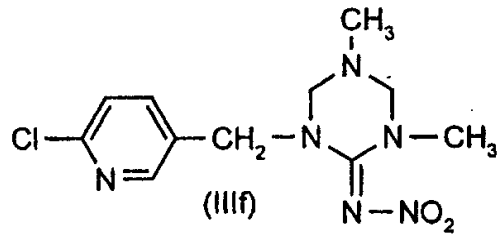
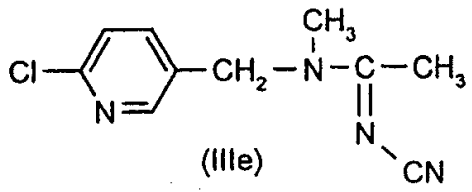




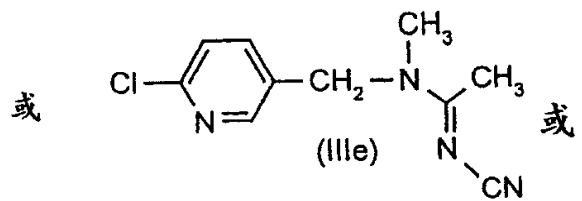
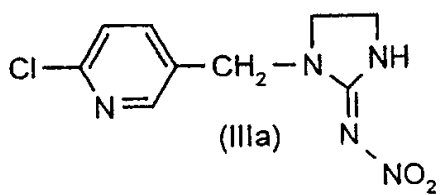
非常特别优选的烟碱的乙酰胆碱受体的激动剂和拮抗剂是下面结构式的化合物：

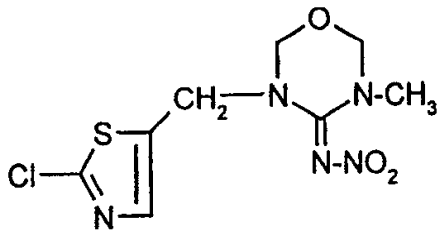
5





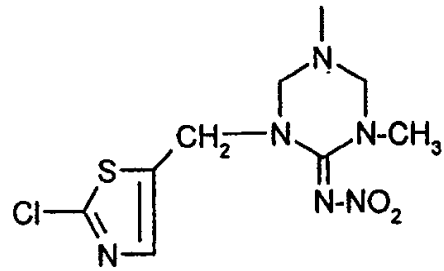
尤其是下面结构式的化合物



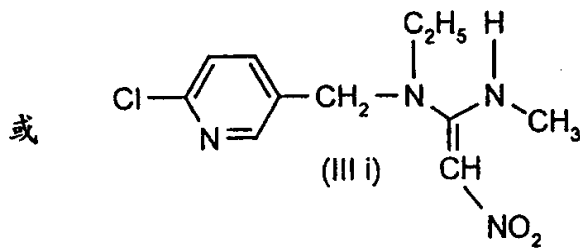


(IIIg)

或

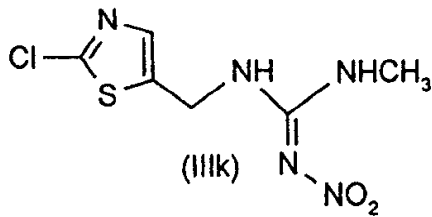


(IIIh)



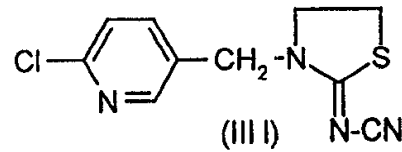
(III i)

或

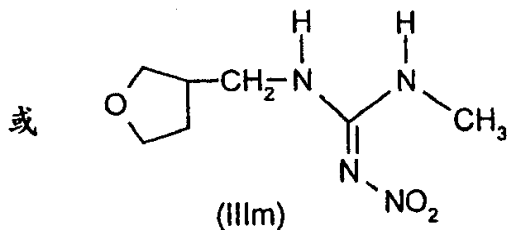


(IIIk)

或



(III l)



(III m)

非常特别优选式 (IIIa), (IIIk), (III l) 的化合物。

5

此外, 非常特别优选式 (IIIe), (IIIg), (IIIh), (III m), (IIIc) 的化合物。

10 这些活性化合物混合物适于防治动物害虫, 特别是农业, 林业, 储藏品保护和卫生领域所遇到昆虫, 蛛形纲和线虫, 并且它们为植物所很好地耐受, 并且对温血动物具有小的毒性。它们对一般敏感性和抗

性物种是有活性的,并且在害虫发育的所有阶段或部分阶段有效。上述害虫包括:

- 等足目 (Isopoda), 例如 *Oniscus aselluse*, 鼠妇 (*Armadillidium vulgare*) 和 *Porcellio scaber*.
- 5 多足纲目 (Diplopoda), 例如 *Blaniulus gutttulatus*.
- 唇足亚纲目 (Chilopoda), 例如 *Geophilus carpophagus* 和 蜘蛛目种 (*Scutigera spec.*).
- 综合纲目 (Symphyla), 例如 *Scutigera immaculata*.
- 10 缨尾目 (Thysanura), 例如 西洋衣鱼 (*Lepisma saccharina*).
- 弹尾目 (Collembola), 例如 *Onychiurus armatus*.
- 直翅目 (Orthoptera), 例如 灶马 (*Acheta domesticus*), 蝼蛄属 (*Gryllotalpa spp.*), 热带飞蝗 (*Locusta migratoria migratorioides*), 长额负蝗 (*Melanoplus differentialis*) 和
- 15 *Schistocerca gregaria*.
- 蟑螂目 (Blattaria), 例如 东方非蟑 (*Blatta orientalis*), 美洲大蟑 (*Periplaneta americana*), 马德拉非蟑 (*Leucophaea maderae*), 德国小蟑 (*Blattella germanica*),
- 20 革翅目 (Dermaptera), 例如 欧洲球蝮 (*Forficula auricularia*).
- 等翅目 (Isoptera), 例如 白蚁属 (*Reticulitermes spp.*).
- 虱目 (Phthiraptera), 例如 头虱 (*Pediculus humanus corporis*), 盲虱属 (*Haematopinus spp.*), 长额虱 (*Linognathus spp.*), 羽虱属
- 25 (*Trichodectes spp.*) 和 *Damalinea spp.*.
- 缨翅目 (Thysanoptera), 例如 温室条蓟马 (*Hercinothrips femoralis*), 棉蓟马 (*Thrips tabaci*), *Thrips palmi* 和 *Frankliniella accidentalis*.
- 异翅亚目 (Heteroptera), 例如 褐盾蝽属 (*Eurygaster spp.*),
- 30 *Dysdercus intermedius*, 甜菜拟网蝽 (*Piesma quadrata*), 臭虫 (*Cimex lectularius*), *Rhodnius prolixus* 和 吸血猎蝽属 (*Triatoma spp.*).

同翅亚目 (Homoptera), 例如 *Aleurodes brassicae*, 棉粉虱 (*Bemisia tabaci*), 温室白粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*), 棉蚜 (*Aphis gossypii*), 甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*), 茶鹿隐瘤额蚜
 5 (*Cryptomyzus ribis*), 蚕豆蚜 (*Aphis fabae*), *Aphis pomi*, 苹果绵蚜 (*Eriosoma lanigerum*), 桃大尾蚜 (*Hyalopterus arundinis*), 葡萄根瘤蚜 (*Phylloxera vastatrix*), 瘦绵蚜属 (*Pemphigus* spp.), *Macrosiphum avenae*, 瘤额蚜 (*Myzus* spp.), 忽布瘤额蚜 (*Phorodon humuli*), 粟缢管蚜 (*Rhopasiphum padi*), 叶蝉属 (*Empoasca* spp.),
 10 *Euscelis bilobatus*, 黑尾叶蝉 (*Nephotettix cincticeps*), 李蜡蚧 (*Lecanium corni*), 油橄榄蝥 (*Saissetia oleae*), 稻灰飞虱 (*Laodelphax striatellus*), 褐稻虱 (*Nilaparvata lugens*), 红圆蚧 (*Aonidiella aurantii*), *Aspidiotus hederæ*, 粉蚧属 (*Pseudococcus* spp.) 和木虱属 (*Psylla* spp.).

15

鳞翅目 (Lepidoptera), 例如, 红铃虫 (*Pectinophora gossypiella*), 松尺蠖 (*Bupalus piniarius*), *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, 樱桃巢蛾 (*Hyponomeuta padella*), 小菜蛾 (*Plutella xylostella*), 天幕毛虫 (*Malacosoma neustria*), *Euproctis chrysorrhoea*, 毒蛾属 (*Lymantria* spp.), 棉叶穿孔潜蛾 (*Bucculatrix thurberiella*), *Phyllocnisti citrella*, 地老虎 (*Agrotis* spp.), 切根虫 (*Euxoa* spp.), 褐夜蛾 (*Feltia* spp.), 埃及金刚钻 (*Earias insulana*), 夜蛾属 (*Heliothis* spp.), 甘蓝夜蛾 (*Mamestra brassicae*), *Panolis flammea*, 夜蛾属 (*Spodoptera* spp.), 粉纹夜蛾 (*Trichoplusia ni*), 苹果蠹蛾 (*Carpocapsa pomonella*), 粉蝶属 (*Pieris* spp.), 螟 (*Chilo* spp.), *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, 大黄螟 (*Galleria mellonella*), 袋衣蛾 (*Tineola bisselliella*), 网衣蛾 (*Tinea pellionella*), 褐织叶蛾 (*Hofmannophila pseudospretella*), *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, 云杉卷叶蛾 (*Choristoneura fumiferana*), 葡萄果蠹蛾 (*Clysia ambiguella*), 茶黄卷叶蛾 (*Homona magnanima*) 和 栎绿卷叶蛾 (*Tortrix viridana*) 和 *Cnaphalocerus* spp..
 20
 25
 30

鞘翅目 (Coleoptera), 例如, 家具窃囊 (*Anobium punctatum*),
Rhizopertha dominica, *Bruchidius obtectus*, 大豆象
(*Acanthoscelides obtectus*), 家天牛 (*Hylotrupes bajulus*),
5 *Agelastica alni*, 甲铃薯甲虫 (*Leptinotarsa decemlineata*),
Phaedon cochleariae, 叶甲属 (*Diabrotica* spp.), 油菜兰跳甲
(*Psylliodes chrysocephala*), 墨西哥豆瓢虫 (*Epilachna*
varivestis), *Atomaria* spp., 锯胸谷盗 (*Oryzaephilus*
surinamens), 象甲属 (*Anthonomus* spp.), 米象属 (*Sitophilus*
10 spp.), *Otiorrhynchus sulcatus*, 香蕉蛛基象甲 (*Cosmopolites*
sordidus), *Ceuthorrhynchus assimilis*, 苜蓿叶象甲 (*Hypera*
posttica), 皮囊属 (*Dermestes* spp.), 皮囊属 (*Trogoderma* spp.),
皮囊属 (*Anthrenus* spp.), 黑皮囊 (*Attagenue* spp.), 粉囊 (*Lyctus*
spp.), *Meligethes aeneus*, 蛛甲属 (*Ptinus* spp.), 金黄蛛甲 (*Niptus*
15 *hdoleucus*), 麦蛛甲 (*Gibbium psylliodes*), 拟谷稻属 (*Tribolium*
spp.), 黄粉甲 (*Tenebrio molitor*), 扣甲属 (*Agriotes* spp.), 金
针虫属 (*Conoderus* spp.), *Melolontha melolontha*, 六月金龟子
(*Amphimallon solstitialis*) 和 *Costelytra zealandica*.

20 膜翅属 (Hymenoptera), 例如锯角叶蜂属 (*Diprion* spp.), 叶蜂属
(*Hoplocampa* spp.), 蚁 (*Lasius* spp.), 厨蚁 (*Monomorium*
pharaonis), 和胡蜂 (*Vespa* spp.).

双翅属 (Diptera), 例如, 啞蚊 (*Aedes* spp.), 斑按蚊属 (*Anopheles*
25 spp.), 库蚊 (*Culex* spp.), 黄猩猩果蝇 (*Drosophila melanogaster*),
家蝇 (*Musca* spp.), 厩蝇 (*Fannia* spp.), 红头丽蝇 (*Calliphora*
erythrocephala), 丝光绿蝇 (*Lucilia* spp.), *Chrysomyia* spp.,
疽蝇属 (*Cuterebra* spp.), *Gastrophilus* spp., *Hyppobosca* spp.,
螫蝇属 (*Stomoxys* spp.), 鼻蝇属 (*Oestrus* spp.), 皮蝇属 (*Hydoderma*
30 spp.), 牛虻属 (*Tabanus* spp.), *Tannia* spp., *Bibio hortulanus*,
瑞典麦杆蝇 (*Oscinella frit*), 麦蝇 (*Phorbia* spp.), 甜菜潜叶花
蝇 (*Pegomyia hyoscyami*), 地中海实蝇 (*Ceratitis capitata*), 油

橄榄实蝇 (*Dacus oleae*), 欧洲大蚊 (*Tipula paludosa*), 种蝇属 (*Hylemyia* spp.) 和潜蝇属 (*Liriomyza* spp.).

5 蚤目 (*Siphonaptera*), 例如, 东方鼠蚤 (*Xenopsylla cheopis*), 和角叶蚤属 (*Ceratophyllus* spp.).

蛛形纲 (*Arachnida*), 例如 *Sciopio maurus*, 黑寡妇球腹蛛 (*Latrodectus mactans*), 粗脚粉螨 (*Acarus siro*), 隐喙蚰属 (*Argas* spp.), 喙蟬属 (*Ornithodoros* spp.), 鸡皮刺蟬 (*Dermanyssus* 10 *gallinae*), *Eriophyes ribis*, 橘锈蟬 (*Phyllocoptruta oleivora*), 牛蟬属 (*Boophilus* spp.), 头蟬属 (*Rhipicephalus* spp.), 花蟬属 (*Amblyomma* spp.), *Hyalomma* spp., 硬蚰 (*Ixodes* spp.), 蟬蟬属 (*Psoroptes* spp.), 恙蟬属 (*Chorioptes* spp.), 疥蟬 (*Sarcoptes* spp.), 线蟬属 (*Tarsonemus* spp.), 苜宿苔蟬 (*Bryobia praetiosa*), 15 红蜘蛛 (*Panonychus* spp.), 和红叶蟬属 (*Tetranychus* spp.), *Hemitarsonemus* spp. 和短须蟬属 (*Brevipalpus* spp.).

植物寄生线虫包括, 例如短体线虫属 (*Pratylenchus* spp.), 穿孔线虫属 (*Radopholus* spp.), 茎线虫属 (*Ditylenchus* spp.), 垫刃线虫属 20 (*Tylenchulus* spp.), 异皮线虫属 (*Heterodera* spp.), 球异皮线虫属 (*Globodera* spp.), 根结线虫属 (*Meloidogyne* spp.), 滑刃线虫属 (*Aphelenchoides* spp.), 长针线虫属 (*Longidorus* spp.), 剑线虫属 (*Xiphinema* spp.), 毛刺线虫属 (*Trichodorus* spp.) 和伞滑壬线虫属 (*Bursaphelenchus* spp.).

25

如果所述活性化合物组合物中的活性化合物以某一重量比存在, 则增效作用特别明显。

30 使用的式 (I) 和/或 (II) 的化合物和式 (III) 的化合物的比例以及混合物的总量取决于昆虫的类型和发生。在各种应用情况下要使用的最佳比例和总量各自可以通过系列试验来测定。一般情况下, 式 (I) 和/或 (II) 的化合物与式 (III) 的化合物的比例是 1:100 至 100:1, 优选



1:25 至 25:1, 特别优选 1:5 至 5:1. 比例以重量份数比表示。

本发明的活性化合物的混合物可以以它们的商售制剂形式以及以从这些制剂制备的使用形式与其它活性化合物的混合物存在, 所述其它活性化合物例如杀昆虫剂, 引诱剂, 杀菌剂, 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, 由微生物制备的物质。用于混合物的具体共组分是上面提到的杀昆虫剂和杀真菌剂。

可以任选混入的杀昆虫剂的例子包括:

- 10 磷酸酯类, 如益棉磷、保棉磷、 α -1-(4-氯苯基)-4-(0-乙基, S-丙基)磷酰氧基吡唑、毒死蜱、蝇毒磷、内吸磷、甲基内吸磷、二嗪农、敌敌畏、乐果、益果、灭线磷、乙嘧硫磷、杀螟硫磷、倍硫磷、庚烯磷、对硫磷、甲基对硫磷、伏杀硫磷、辛硫磷、嘧啶磷、甲基嘧啶磷、丙溴磷、丙硫磷、甲丙硫磷、三唑磷和敌百虫;
- 15 氨基甲酸酯类, 如涕灭威、噁虫威、 α -2-(1-甲基丙基)苯基甲基氨基甲酸酯、丁酮威、丁酮氧威、甲萘威、克百威、丁硫克百威、除线威、叶蝉散、灭多威、杀线威、抗蚜威、猛杀威、残杀威和硫双威;
有机硅化合物, 优选二甲基(苯基)甲硅烷基-甲基 3-苯氧基苄基醚, 如二甲基-(4-乙氧基苯基)-甲硅烷基-甲基 3-苯氧基苄基醚, 或(二甲
- 20 基苯基)-甲硅烷基-甲基 2-苯氧基-6-吡啶基甲基醚, 如二甲基-(9-乙氧基-苯基)-甲硅烷基甲基 2-苯氧基-6-吡啶基甲基醚, 或[(苯基)-3-(3-苯氧基苯基)-丙基](二甲基)-硅烷, 如[(4-乙氧基苯基)-[3-(4-氯-3-苯氧基苯基)-丙基]二甲基-硅烷, 氟硅菊酯;
拟除虫菊酯类, 如烯丙菊酯、甲体氯氟菊酯、生物苄呋菊酯、联苯菊酯、乙氟菊酯、氟氟氟菊酯、溴氟菊酯、氯氟氟菊酯、氯氟菊酯、溴
- 25 氟菊酯、 α -氟基-3-苯基-2-甲基苄基-2, 2-二甲基-3-(2-氯-2-三氟甲基乙烯基)环丙烷羧酸酯、甲氟菊酯、五氟菊酯、氟戊菊酯、氟氟戊菊酯、氟氟苯菊酯、氟胺氟菊酯、氯菊酯、苄呋菊酯和四溴菊酯;
硝基亚胺类和硝基亚甲基化合物, 如 1-[(6-氯-3-吡啶基)-甲基-4, 5-
- 30 二氢-N-硝基-1H-咪唑-2-胺(吡虫啉)、N-[(6-氯-3-吡啶基)-甲基]-N2-氟基-N1-甲基乙酰胺(NI-25);
齐墩螨素、AC 303 630、乙酰甲胺磷、氟酯菊酯、棉铃威、氧涕灭威、

艾氏剂、双虫脒、甲基吡啶磷、苏芸金杆菌、亚胺硫磷、磷胺、磷化氢、炔酮菊酯、丙虫磷、胺丙畏、发果、吡唑硫磷、除虫菊酯、哒螨酮、哒嗪硫磷、蚊蝇醚、喹硫磷、RH-7988、雷藤酮、氯化钠、六氟硅酸钠、治螟磷、甲基磺酰氟、焦油、伏虫隆、七氟菊酯、双硫磷、特丁磷、杀虫畏、胺菊酯、0-2-叔丁基嘧啶-5-基-邻-异丙基-硫代磷酸酯、杀虫环、久效威、二甲硫吸磷、四溴菊酯、杀虫隆、混灭威、蚜灭多、乳菇轮枝孢、灭除威、灭杀威、丙硫克百威、杀虫磺、氟氯菊酯、生物丙烯菊酯、MER生物丙烯菊酯、(S)-环戊烯基异构体、溴硫磷、乙基溴硫磷、噻嗪酮、灭线磷、多硫化钙、三硫磷、杀螟丹、灭螨猛、氯丹、毒虫畏、定虫隆、氯甲硫磷、氯化苦、毒死婢、杀螟磷、氟氯氟菊酯、甲体氟氯菊酯、苯醚氟菊酯、灭蝇胺、棉隆、滴滴涕、砒吸磷、杀螨隆、氯亚胺硫磷、百治磷、除虫脲、地乐酚、deoxabenzofos、daizacarb、乙拌磷、二硝酚、烯炔菊酯、硫丹、苯硫磷、高氟戊菊酯、乙硫苯威、乙硫磷、醚菊酯、仲丁威、双氧威、线虫磷、氟虫腈、氟螨脲、氟醚菊酯(flufenprox)、氟虫脲、地虫硫磷、伐虫脒、安果、丁苯硫磷、吡线威、七氟、氟幼脲、伏蚁脲、氟化氢、烯虫乙酯、丰丙磷、氯唑磷、异丙胺磷、稻瘟灵、噁唑磷、碘硫磷、噁嗪菊酯、林丹、马拉硫磷、灭蚜婢、地安磷、甘汞、安百亩、metarthizium, anisopliae、虫螨畏、甲胺磷、杀扑磷、灭梭威、烯虫酯、甲氧滴滴涕、敌线酯、速灭威、速来磷、久效磷、二溴磷、Neodiprion sertifer NPV、烟碱、氧乐果、亚砒吸磷、五氟酚、石油、苯醚菊酯、稻丰散、甲拌磷。

可以任选混入的其它杀昆虫剂也可以来自通式(I)的化合物类。

可以任选混入的杀真菌剂优选是：

25 三唑类，如
 戊环唑、环丙唑、戊唑醇、环唑醇、叶菌唑、杀草强、三唑锡、BAS 480F、双苯三唑醇、噁醚唑、腈苯唑、解草唑、fenethanil、氟唑唑、氟硅唑、粉唑醇、酰胺唑、isozofos、腈菌唑、多效唑、(±)-顺-1-(4-氟苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-环己醇、氟醚唑、三唑酮、三唑醇、抑芽唑、氟菌唑、灭菌唑、烯效唑及其金属盐和酸加成物。

30 咪唑类，如
 抑霉唑、稻瘟酯、咪鲜安、氟菌唑、2-(1-叔丁基)-1-(2-氟苯基)-

- 3-(1, 2, 4-三唑-1-基)-丙-2-醇, 噻唑羧酰苯胺类如 2', 6'-二溴-2-甲基-4-三氟甲氧基-4'-三氟甲基-1, 3-噻唑-5-羧酰苯胺、1-咪唑基-1-(4'-氯苯氧基)-3, 3-二甲基丁-2-酮, 及其金属盐和酸加成物。
- (E)-2-[2-[6-(2-氟苯氧基)噻啉-4-基氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[6-(2-硫代酰氨基苯氧基)噻啉-4-基氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[6-(2-氟苯氧基)噻啉-4-基氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[6-(2, 6-二氟苯氧基)噻啉-4-基氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[3-(噻啉-2-基氧基)苯氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[3-(5-甲基噻啉-2-基氧基)-苯氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[3-(苯基磺酰氧基)苯氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[3-(4-硝基苯氧基)苯氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-苯氧基苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(3, 5-二甲基苯甲酰基)吡咯-1-基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(3-甲氧基苯氧基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(2-苯乙烯-1-基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(3, 5-二氟苯氧基)吡啉-3-基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(3-(1, 1, 2, 2-四氟乙氧基)苯氧基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[3-(α -羟基苄基)苯氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(4-苯氧基吡啉-2-基氧基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(3-正丙氧基苯氧基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(3-异丙氧基苯氧基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(3-(2-氟苯氧基)苯氧基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(3-乙氧基苯氧基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(4-叔丁基吡啉-2-基氧基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[3-(3-氟苯氧基)苯氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(3-甲基吡啉-2-基氧基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[6-(2-甲基苯氧基)噻啉-4-基氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(5-溴吡啉-2-基氧基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-(3-(3-碘吡啉-2-基氧基)苯氧基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[6-(2-氯吡啉-3-基氧基)噻啉-4-基氧基]苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E), (E)-2-[2-(5, 6-二甲基吡嗪-2-基甲氧基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-[2-[6-(6-甲基吡啉-

- 2-基氧基)嘧啶-4-基氧基]苯基}-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E), (E)-2-
 {2-(3-甲氧基苯基)甲基胍基甲基]苯基}-3-甲氧基丙烯酸甲酯、
 (E)-2-{2-[6-(2-叠氮基苯氧基)-嘧啶-4-基氧基]苯基}-3-甲氧基丙
 烯酸甲酯、(E), (E)-2-{2-[6-苯基嘧啶-4-基甲基胍基甲基]苯基}-3-
 5 甲氧基丙烯酸甲酯、(E), (E)-2-{2-[(4-氯苯基)甲基胍基甲基]苯
 基}-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E)-2-{2-[6-(2-正丙基苯氧基)-1,3,5-
 三嗪-4-基氧基]苯基}-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E), (E)-2-{2-[(3-硝
 基苯基)甲基胍基甲基]苯基}-3-甲氧基丙烯酸甲酯;
 琥珀酸脱氢酶抑制剂, 如
- 10 甲唑酰苯胺、二甲唑酰苯胺、环菌胺、拌种胺、拌种灵(seedvax)、
 噻菌胺、pyrocarbolid、氧化莠锈灵、防霉胺、灭锈胺、邻碘酰苯胺、
 氟酰胺;
 萘衍生物, 如特比萘芬、萘替芬、布替萘芬、3-氯-7-(2-氮杂-2,7,7-
 三甲基-辛-3-烯-5-炔);
- 15 磺胺类, 如苯氧磺胺、甲苯氧磺胺、灭菌丹、氟灭菌丹(fluorfolpet);
 克菌丹、敌菌丹;
 苯并咪唑类, 如多菌灵、苯菌灵、唑线威、麦穗宁、甲基菌硫灵、噻
 菌灵及其盐;
 吗啉衍生物, 如丁苯吗啉、falimorph、烯酰吗啉、十二环吗啉、
 20 aldimorph、苯锈啶及其芳磺酸盐类, 例如对甲苯磺酸和对十二烷基
 苯基磺酸;
 二硫代氨基甲酸酯类, 如代森盐、代森铁、代森锰铜、代森锰锌、代
 森锰、威百亩、代森联、福美双、代森锌、福美铵;
 苯并噻唑类, 如2-巯基苯并噻唑;
- 25 苯甲酰胺类, 如2,6-二氯-N-(4-三氯甲基苄基)-苯甲酰胺;
 硼化合物, 如硼酸、硼酸酯、硼砂;
 甲醛及甲醛释放化合物, 如苄基醇单(多)半缩甲醛、恶唑啉、六氢均
 三嗪类、N-羟甲基氯乙酰胺、多聚甲醛、三氯甲基吡啶、奥索利酸、
 叶枯酞;
- 30 三-N-(环己基二氮烯鎓二氧基)-铝、N-(环己基二氮烯鎓二氧基)-三丁
 基锡或钾盐、双-N-(环己基二氮烯鎓二氧基)-铜;
 N-甲基异噻唑啉-3-酮、5-氯-N-甲基异噻唑啉-3-酮、4,5-二氯-N-

- 辛基异噻唑啉-3-酮、N-辛基-异噻唑啉-3-酮、4,5-三亚甲基-异噻唑啉酮、4,5-苯并异噻唑啉酮、N-羟甲基氯乙酰胺；
- 醛类，如月桂醛、甲醛、戊二醛、 β -溴月桂醛；
- 硫氰酸酯类，如硫代氰基甲硫基苯并噻唑、甲撑双硫氰酸酯等；
- 5 季铵盐化合物，如苄基二甲基十四烷基氯化铵、苄基二甲基十二烷基氯化铵、二癸基二甲基氯化铵；
- 碘衍生物，如二碘甲基对甲苯基砒、3-碘-2-丙炔醇、4-氯苯基-3-碘炔丙基缩甲醛、3-溴-2,3-二碘-2-丙烯基乙基氨基甲酸酯、2,3,3-三碘烯丙基醇、3-溴-2,3-二碘-2-丙烯基醇、3-碘-2-丙炔基正丁基氨基甲酸酯、3-碘-2-丙炔基正己基氨基甲酸酯、3-碘-2-丙炔基环己基氨基甲酸酯、3-碘-2-炔丙基苯基氨基甲酸酯；
- 10 苯酚衍生物，如三溴苯酚、四氯苯酚、3-甲基-4-氯苯酚、3,5-二甲基-4-氯苯酚、苯氧基乙醇、二氯苯酚、邻苯基苯酚、间苯基苯酚、对苯基苯酚、2-苄基-4-氯苯酚及其碱金属和碱土金属盐；
- 15 具有活化的卤素基团的杀微生物剂，如氯乙酰胺、溴硝丙二醇、bronidox、tectemer，如2-溴-2-硝基-1,3-丙二醇、2-溴-4'-羟基-乙酰苯、2,2-二溴-3-脞-丙酰胺、1,2-二溴-2,4-二氟基丁烷、 β -溴- β -硝基苯乙烯；
- 吡啶类，如1-羟基-2-吡啶硫酮(及其钠、铁、锰和锌盐)、四氯-4-20 甲基磺酰基吡啶、嘧啶甲醇、嘧菌胺、吡菌硫、1-羟基-4-甲基-6-(2,4,4-三甲基戊基)-2(1H)-吡啶；
- 金属皂，如环烷酸锡、环烷酸铜、环烷酸锌、辛酸锡、辛酸铜、辛酸锌、2-乙基己酸锡、2-乙基己酸铜、2-乙基己酸锌、油酸锡、油酸铜、油酸锌、磷酸锡、磷酸铜、磷酸锌、苯甲酸锡、苯甲酸铜和苯甲酸锌；
- 25 金属盐，如碱式碳酸铜、重铬酸钠、重铬酸钾、铬酸钾、硫酸铜、氯化铜、硼酸铜、氟硅酸锌、氟硅酸铜，特别是与固定剂的混合物；
- 氧化物，如三丁基锡氧化物、氧化亚铜、氧化铜、氧化锌；
- 二烷基二硫代氨基甲酸酯类，如二烷基二硫代氨基甲酸酯的钠盐和锌盐、四甲基秋兰姆二氧化物、N-甲基-二硫代氨基甲酸酯钾盐；
- 30 脞类，如2,4,5,6-四氯间苯二脞、氟基二硫代亚氨基氨基甲酸酯二钠盐；
- 噻啉类，如8-羟基噻啉及其铜盐；

粘氨酸、5-羟基-2(5H)-咪喃酮;

4,5-二氯二噻唑啉酮、4,5-苯并二噻唑啉酮、4,5-三亚甲基二噻唑啉酮、4,5-二氯-(3H)-1,2-二硫羧-3-酮、3,5-二甲基-四氢-1,3,5-噻二嗪-2-硫酮、N-(2-对氯苯甲酰乙基)-六铵氯化物、N-羟基甲基-N'-

5 甲基-二硫代氨基甲酸酯钾盐,

2-氧代-2-(4-羟基-苯基)乙酰氧脲酸氯化物,

苯基-(2-氯-氟基-乙烯基)砒,

苯基-(1,2-二氯-2-氟基-乙烯基)砒;

含银、锌或铜的沸石,它们可以单独或包封在聚合的活性化合物中。

10 或者还有多种上述杀真菌剂的混合物。

从商业制剂制备的使用形式的活性化合物含量可以在一个宽的限定内变化。该使用形式的活性化合物浓度可以是0.0000001-95%重量的活性化合物,优选0.0001-1%重量。

15 活性化合物的混合物可以配制成常规制剂,例如溶液、乳剂、悬浮剂、粉末剂、泡沫剂、糊剂、颗粒剂、气雾剂、浸有活性化合物的天然和合成材料、聚合物中非常细微的胶囊和用于种子的包被组合物,还有发烟制剂,例如熏蒸筒,熏蒸罐,熏蒸片等等,还有ULV冷雾和暖雾制剂。

20

这些制剂用已知的方式制备,例如,将活性化合物与扩充剂即液体溶剂,加压液化气体和/或固体载体混合,任选地使用表面活性剂,即乳化剂和/或分散剂和/或起泡剂。如果用水作扩充剂,则也可以用例如有机溶剂作助溶剂。合适的液体溶剂主要有:芳香族化合物,如二甲苯,甲苯或烷基萘,氯代芳香族化合物和氯代脂肪烃,如氯代苯类、氯乙烯类或二氯甲烷,脂肪烃,如环己烷或石蜡,例如矿物油馏份,醇类,如丁醇或乙二醇以及其醚和酯,酮类,如丙酮、甲乙酮、甲基异丁基酮或环己酮,强极性溶剂,如二甲基甲酰胺和二甲亚砒,以及水;液化气体扩充剂或载体是指常温常压下是气体的液体,例如气雾抛射剂,例如卤代烃类,还有丁烷,丙烷,氮和二氧化碳;合适的固

25 体载体是:例如磨碎的天然矿物质如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、硅镁土、蒙脱石或硅藻土,和磨碎的合成矿物质,如高分散二氧

30

化硅、矾土和硅酸盐；用于颗粒剂的适合的固体载体有：例如压碎和破碎的天然矿物质如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石，以及有机和无机粉的合成颗粒，和如下有机物的颗粒：例如锯木屑、椰壳、玉米穗轴和烟茎；作为乳化剂和/或起泡剂合适的有：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，芳基磺酸盐以及蛋白水解产物；合适的分散剂有：例如，木素亚硫酸废液和甲基纤维素。

10 制剂中，可以使用粘合剂，如羧甲基纤维素和粉状、颗粒或乳胶形式的天然和合成聚合物，如阿拉伯胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯，以及天然磷脂，如脑磷脂和卵磷脂，和合成磷脂。其它的添加剂可以是矿物油和植物油。

15 也可以使用着色剂，如无机颜料，例如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝，和有机染料，如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料，和微量营养素如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

一般情况下，制剂含有 0.1 - 95% 重量百分比的活性化合物混合物，优选 0.5-90% 重量百分比的活性化合物混合物。

20 本发明的混合物可以通过土壤施用。

本发明的混合物可以通过叶子施用。

本发明的混合物可以特别有利地用于拌种。

此外，本发明的混合物可以优选通过土壤施用。

25 此外，也可以通过灌溉系统施用本发明的混合物，例如通过用于灌溉的水。

此外发现，也可以分开施用本发明的混合物的活性成分，例如将 spinosyn(s) 施用给土壤，有利地是以合适的制剂形式，和通过叶子施用式(III)的化合物，有利地是以合适的制剂形式，或者反之。

30

应用实施例

实施例 1

叶用杀昆虫制剂抗吸虫的活性

使用临界浓度试验检测杀昆虫活性。通过将各浓度稀释 5 倍, 从各试验制剂得到一系列水稀释液。

为了测定增效活性, 低活性浓度的氯烟酸基化合物与各种活性化合物浓度的 Tracer (Spinosad) 混合。

使用的试验植物是感染有桃蚜 (*Myzus persicae*) 的一叶期卷心菜植株。将有蚜虫的枝条或叶浸入到各液体中大约 3 秒钟。接着将试验品放在 21℃ 且 65% 相对大气湿度的温室中。

2 和 7 天后对死亡率进行评定。

表 1：化合物 (IIIa) 和 Spinosad 的混合物

Act. compd. conc. (% a.i.)	卷心菜上的桃蚜/以 % 表示的杀死率					
	2天后评价			7天后评价		
	Spinosad	化合物 (IIIa) 0.0008 % a.i.	Spinosad & 化合物 (IIIa)	Spinosad	化合物 (IIIa) 0.0008 % a.i.	Spinosad & 化合物 (IIIa)
0.1	0	90	100	0	78	100
0.02	0	90	100	0	78	100
0.004	0	90	100	0	78	100
0.0008	0	90	97	0	78	92
0.00016	0	90	95	0	78	86
Spinosad	Spinosad	化合物 (IIIa) 0.00016 % a.i.	Spinosad & 化合物 (IIIa)	Spinosad	化合物 (IIIa) 0.00016 % a.i.	Spinosad & 化合物 (IIIa)
0.1	0	18	95	0	2	99
0.02	0	18	89	0	2	99
0.004	0	18	86	0	2	80
0.0008	0	18	56	0	2	33
0.00016	0	18	19	0	2	3
对照			0			0

Act. compd. conc. = 活性化合物浓度

a.i. = 活性成分

表 2：化合物 (IIIg) 和 Spinosad 的混合物

Act. compd. conc. (% a.i.)	卷心菜上的桃蚜/以 % 表示的杀死率					
	2天后评价			7天后评价		
	Spinosad	化合物 (IIIg) 0.0008 % a.i.	Spinosad & 化合物 (IIIg)	Spinosad	化合物 (IIIg) 0.0008 % a.i.	Spinosad & 化合物 (IIIg)
0.1	0	79	100	0	70	100
0.02	0	79	100	0	70	100
0.004	0	79	96	0	70	98
0.0008	0	79	90	0	70	91
Spinosad	Spinosad	化合物 (IIIg) 0.00016 % a.i.	Spinosad & 化合物 (IIIg)	Spinosad	化合物 (IIIg) 0.00016 % a.i.	Spinosad & 化合物 (IIIg)
0.1	0	0	87	0	0	77
0.02	0	0	85	0	0	98
0.004	0	0	63	0	0	33
对照			0			0

Act. compd. conc. = 活性化合物浓度

a.i. = 活性成分

表3：化合物（IIIk）和Spinosad的混合物

Act. compd. (% a.i.)	卷心菜上的桃蚜/以%表示的杀死率					
	2天后评价			7天后评价		
	Spinosad	化合物 (IIIk) 0.0008 % a.i.	Spinosad & 化合物 (IIIk)	Spinosad	化合物 (IIIk) 0.0008 % a.i.	Spinosad & 化合物 (IIIk)
0.1	0	48	100	0	28	100
0.02	0	48	100	0	28	100
0.004	0	48	98	0	28	100
0.0008	0	48	97	0	28	99
0.00016	0	48	90	0	28	82
Spinosad	Spinosad	化合物 (IIIk) 0.00016 % a.i.	Spinosad & 化合物 (IIIk)	Spinosad	化合物 (IIIk) 0.00016 % a.i.	Spinosad & 化合物 (IIIk)
0.1	0	10	95	0	2	98
0.02	0	10	97	0	2	54
0.004	0	10	84	0	2	55
0.0008	0	10	35	0	2	27
对照			0			0

Act. compd. conc. = 活性化合物浓度

a.i. = 活性成分

表 4：化合物 (III I) 和 Spinosad 的混合物

Act. compd. conc. (% a.i.)	卷心菜上的桃蚜/以 % 表示的杀死率					
	2天后评价			7天后评价		
	Spinosad	化合物 (III I) 0.0008 % a.i.	Spinosad & 化合物 (III I)	Spinosad	化合物 (III I) 0.0008 % a.i.	Spinosad & 化合物 (III I)
0.1	0	85	100	0	38	100
0.02	0	85	100	0	38	99
0.004	0	85	100	0	38	83
0.0008	0	85	93	0	38	95
0.00016	0	85	83	0	38	53
Spinosad	Spinosad	化合物 (III I) 0.00016 % a.i.	Spinosad & 化合物 (III I)	Spinosad	化合物 (III I) 0.00016 % a.i.	Spinosad & 化合物 (III I)
0.1	0	8	94	0	0	94
0.02	0	8	94	0	0	82
0.004	0	8	93	0	0	54
0.0008	0	8	53	0	0	20
0.00016	0	8	22	0	0	2
对照			0			0

Act. compd. conc. = 活性化合物浓度

a.i. = 活性成分

实施例 2临界浓度试验/根系作用

试验昆虫： 蚕豆蚜 (Aphis fabae)
 溶剂： 4 份重量的丙酮
 5 乳化剂： 1 份重量的烷基芳基聚乙二醇醚

为了制备合适的活性化合物制剂, 将 1 份重量的活性化合物与所述量的溶剂混合, 加入所述量的乳化剂, 并且用水将浓缩物稀释到期望的浓度。

10 活性化合物制剂与土壤充分混合。制剂中活性化合物的浓度实际上不是关键的, 只有以 ppm (=mg/l) 表示的每单位体积土壤施用的活性化合物的重量是决定性的。将处理过的土壤装入 250 毫升的小盆, 并且在小盆中种入发芽前的蚕豆。用这种方法, 植物的根可以从土壤摄取活性化合物并且传输给叶。

15 为了证实根系作用, 7 天后使上述试验动物聚集在叶上。又 7 天后, 通过估计死亡的动物评价试验。从伤害指数推算活性化合物的根系作用。当所有的试验动物都被杀死时该指数是 100%, 而未处理对照一样多的试验昆虫仍然存活时该指数是 0%。

下面的表中给出了活性化合物, 施用比例和结果:

20 表
根系
蚕豆蚜

活性化合物	下面活性化合物浓度时 以%表示的伤害程度
Spinosad	40ppm=0%
化合物 (IIIa)	0.035ppm=50%
根据本发明的 Spinosad	40ppm
+化合物 (IIIa)	+0.035ppm=80%

30

实施例 3临界浓度试验/根系作用

试验昆虫： 辣根猿叶甲幼虫
 溶剂： 4份重量的丙酮
 乳化剂： 1份重量的烷基芳基聚乙二醇醚

5 为了制备合适的活性化合物制剂，将1份重量的活性化合物与所述量的溶剂混合，加入所述量的乳化剂，并且用水将浓缩物稀释到期望的浓度。

10 活性化合物制剂与土壤充分混合。制剂中活性化合物的浓度实际上不是关键的，只有以ppm(=mg/l)表示的每单位体积土壤施用的活性化合物的重量是决定性的。将处理过的土壤装入500毫升的小盆，在大约1厘米深处种入8颗卷心菜种子，将坑填满并且小心弄平土壤表面。

15 为了证实根系作用，9天后使上述试验动物聚集在叶上。又3天后，通过评价处理过的和未处理的植物的叶子被食的情况评价试验。如果与未处理对照物相比较只发现小的噬咬损伤，则效果是100%；而当整个卷心菜都被噬咬时效果是0%。

下面的表中给出了活性化合物，施用比例和结果：

表
根系

辣根猿叶甲幼虫

20

活性化合物

下面活性化合物浓度时
以%表示的伤害程度

	Spinosad	2.50ppm=50%
	化合物(IIIh)	0.60ppm=0%
25	根据本发明的 Spinosad	2.50ppm
	+化合物(IIIh)	+5.00ppm=90%
	化合物(IIIi)	2.50ppm=0%
	根据本发明的 Spinosad	2.50ppm
	+化合物(IIIi)	+2.50ppm=90%
30	化合物(IIIe)	5.00ppm=0%
	根据本发明的 Spinosad	2.50ppm
	+化合物(IIIe)	+5.00ppm=98%

	化合物(IIIa)	1.25ppm=0%
根据本发明的	Spinosad	2.50ppm
	+化合物(IIIa)	+1.25ppm=80%
	化合物(IIIk)	0.30ppm=0%
5 根据本发明的	Spinosad	2.50ppm
	+化合物(IIIk)	+0.30ppm=80%
	化合物(IIIg)	0.30ppm=50%
根据本发明的	Spinosad	2.50ppm
	+化合物(IIIg)	+0.30ppm=80%

10