

(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 102448299 A

(43) 申请公布日 2012.05.09

(21) 申请号 201080024919.4

A01G 13/00(2006.01)

(22) 申请日 2010.05.21

A01N 37/36(2006.01)

(30) 优先权数据

2009-125900 2009.05.25 JP

A01N 37/50(2006.01)

(85) PCT申请进入国家阶段日

2011.11.25

A01N 43/40(2006.01)

A01N 43/54(2006.01)

(86) PCT申请的申请数据

PCT/JP2010/059052 2010.05.21

A01N 43/88(2006.01)

A01N 47/24(2006.01)

A01P 3/00(2006.01)

(87) PCT申请的公布数据

W02010/137673 EN 2010.12.02

(71) 申请人 住友化学株式会社

地址 日本东京都

(72) 发明人 仓桥真

(74) 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

72001

代理人 孙秀武 高旭轶

(51) Int. Cl.

A01N 37/30(2006.01)

A01C 1/06(2006.01)

A01C 1/08(2006.01)

权利要求书 1 页 说明书 16 页

(54) 发明名称

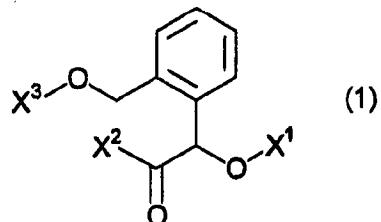
防治植物病害的组合物和方法

(57) 摘要

本发明提供：防治植物病害的组合物，该组合物包括作为活性成分的4-氧代-4-[（2-苯基乙基）氨基]-丁酸和醌外部抑制剂；防治植物病害的方法，其包括将有效量的4-氧代-4-[（2-苯基乙基）氨基]-丁酸和醌外部抑制剂施加至植物或生长植物的土壤等。

1. 防治植物病害的组合物,其包括作为活性成分的 4- 氧代 -4-[ (2- 苯基乙基 ) 氨基 ]- 丁酸和醍外部抑制剂。

2. 根据权利要求 1 所述的组合物,其中所述醍外部抑制剂是选自 : 苯氧菌酯, 噻菌酯, 肝菌酯, 氟噻菌酯, 吡唑醚菌酯, 醐菌胺, 吡菌苯威, 苯氧菌胺, 肝醚菌胺, 烯肝菌酯和通式 (1) 的化合物中至少一种醍外部抑制剂,



其中  $X^1$  表示甲基,二氟甲基或乙基;  $X^2$  表示甲氧基或甲基氨基;且  $X^3$  表示苯基,2- 甲基苯基或 2,5- 二甲基苯基。

3. 根据权利要求 1 所述的组合物,其中 4- 氧代 -4-[ (2- 苯基乙基 ) 氨基 ]- 丁酸与所述醍外部抑制剂的重量比在 0.005 : 1-1000 : 1 范围。

4. 种子处理剂,其包括作为活性成分的 4- 氧代 -4-[ (2- 苯基乙基 ) 氨基 ]- 丁酸和醍外部抑制剂。

5. 用有效量的 4- 氧代 -4-[ (2- 苯基乙基 ) 氨基 ]- 丁酸和醍外部抑制剂处理的植物种子。

6. 防治植物病害的方法,其包括将有效量的 4- 氧代 -4-[ (2- 苯基乙基 ) 氨基 ]- 丁酸和醍外部抑制剂施加至植物或生长植物的土壤。

7. 4- 氧代 -4-[ (2- 苯基乙基 ) 氨基 ]- 丁酸和醍外部抑制剂联合用于防治植物病害的用途。

## 防治植物病害的组合物和方法

### 技术领域

[0001] 本发明涉及防治植物病害的组合物和防治植物病害的方法。

### 背景技术

[0002] 作为植物生长调节剂的活性成分,已知 4- 氧代 -4-[ (2- 苯基乙基 ) 氨基 ]- 丁酸 ( 日本专利 No. 4,087,942) 。已知醌外部抑制剂 (quinone outside inhibitor) ( 以下,在一些情况下称作 QoI ) 是防治植物病害的药剂的活性成分。 (WO 95/27693 ;The Pesticide Manual-14th edition, 由 British Crop Protection Council (BCPC) 出版, ISBN1901396142) 。

### 发明内容

[0003] 本发明的目的是提供对于植物病害具有优异的防治效力的防治植物病害的组合物和防治植物病害的方法。

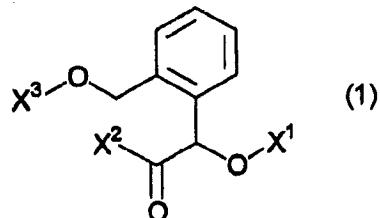
[0004] 本发明提供防治植物病害的组合物和防治植物病害的方法,其中通过 4- 氧代 -4-[ (2- 苯基乙基 ) 氨基 ]- 丁酸和 QoI 的联合使用提高了对植物病害的防治效力。

[0005] 具体地说,本发明采取下列组成:

[0006] [1] 防治植物病害的组合物,其包括作为活性成分的 4- 氧代 -4-[ (2- 苯基乙基 ) 氨基 ]- 丁酸和醌外部抑制剂;

[0007] [2] 根据 [1] 的组合物,其中所述醌外部抑制剂是选自:苯氧菌酯,嘧菌酯,肟菌酯,氟嘧菌酯,啶氧菌酯,吡唑醚菌酯,醚菌胺,吡菌苯威 (pyribencarb),苯氧菌胺,肟醚菌胺,烯肟菌酯 (enestrobin) 和通式 (1) 的化合物中的至少一种醌外部抑制剂,

[0008]



[0009] 其中  $X^1$  表示甲基,二氟甲基或乙基;  $X^2$  表示甲氧基或甲基氨基;且  $X^3$  表示苯基,2- 甲基苯基或 2,5- 二甲基苯基;

[0010] [3] 根据 [1] 的组合物,其中 4- 氧代 -4-[ (2- 苯基乙基 ) 氨基 ]- 丁酸与所述醌外部抑制剂的重量比在 0.005 : 1-1000 : 1 范围;

[0011] [4] 种子处理剂,它包括作为活性成分的 4- 氧代 -4-[ (2- 苯基乙基 ) 氨基 ]- 丁酸和醌外部抑制剂;

[0012] [5] 用有效量的 4- 氧代 -4-[ (2- 苯基乙基 ) 氨基 ]- 丁酸和醌外部抑制剂处理的植物种子;

[0013] [6] 防治植物病害的方法,它包括将有效量的 4- 氧代 -4-[ (2- 苯基乙基 ) 氨

基]-丁酸和醌外部抑制剂施加至植物或生长植物的土壤;和

[0014] [7]4-氧代-4-[ (2-苯基乙基) 氨基]-丁酸和醌外部抑制剂联合用于防治植物病害的用途;等。

[0015] 本发明的组合物对于植物病害显示出优异的防治效力。

## 具体实施方式

[0016] 用于本发明的防治植物病害的组合物中的一种化合物是4-氧代-4-[ (2-苯基乙基) 氨基]-丁酸(以下,在一些情况下称为化合物I),它是公开于日本专利No. 4,087,942中的化合物并且能够例如通过在该专利出版物中描述的方法来生产。

[0017] 化合物I,4-氧代-4-[ (2-苯基乙基) 氨基]-丁酸,可以是与碱形成的盐。4-氧代-4-[ (2-苯基乙基) 氨基]-丁酸的碱式盐的例子包括下列:

[0018] 金属盐如碱金属盐和碱土金属盐,其中包括钠、钾或镁的盐;

[0019] 与氨形成的盐;和

[0020] 与有机胺如吗啉,哌啶,吡咯烷,单低级烷基胺,二低级烷基胺,三低级烷基胺,一羟基低级烷基胺,二羟基低级烷基胺和三羟基低级烷基胺所形成的盐。

[0021] 用于本发明的防治植物病害的组合物中的QoI的例子包括选自:苯氧菌酯,嘧菌酯,肟菌酯,氟嘧菌酯,啶氧菌酯,吡唑醚菌酯,醚菌胺,肟菌苯威,苯氧菌胺,肟醚菌胺,烯肟菌酯和通式(1)的化合物中至少一种醌外部抑制剂。这些QoI是现有技术中已知的化合物并且公开于“the Pesticide Manual-14th edition”,由British Crop Protection Council(BCPC)出版,ISBN1901396142的第54,351,499,636,719,842,900,982和1074页中或公开于WO 95/27693中的。这些QoI能够从销售商获得或通过使用现有技术中已知的方法来制备。

[0022] 下面描述用于本发明的防治植物病害的组合物中的QoI的通式(1)的化合物。

[0023] 通式(1)的化合物的例子包括下面化合物:

[0024] 其中在通式(1)中X<sup>1</sup>是甲基,二氟甲基或乙基的化合物;

[0025] 其中在通式(1)中X<sup>1</sup>是甲基的化合物;

[0026] 其中在通式(1)中X<sup>2</sup>是甲氧基或甲基氨基的化合物;

[0027] 其中在通式(1)中X<sup>1</sup>是甲基和X<sup>2</sup>是甲氧基的化合物;

[0028] 其中在通式(1)中X<sup>1</sup>是甲基和X<sup>2</sup>是甲基氨基的化合物;

[0029] 其中在通式(1)中X<sup>3</sup>是苯基,2-甲基苯基或2,5-二甲基苯基的化合物;

[0030] 其中在通式(1)中X<sup>3</sup>是苯基或2,5-二甲基苯基的化合物;

[0031] 其中在通式(1)中X<sup>1</sup>是甲基,X<sup>2</sup>是甲氧基,和X<sup>3</sup>是2,5-二甲基苯基的化合物;

[0032] 其中在通式(1)中X<sup>1</sup>是甲基,X<sup>2</sup>是甲基氨基,和X<sup>3</sup>是苯基的化合物;和

[0033] 其中在通式(1)中X<sup>1</sup>是甲基,X<sup>2</sup>是甲基氨基,和X<sup>3</sup>是2,5-二甲基苯基的化合物。

[0034] 下面显示通式(1)的化合物的特定例子。

[0035] 在通式(1)的化合物中,X<sup>1</sup>,X<sup>2</sup>和X<sup>3</sup>是在表1中所示的基团的组合中的一种。

[0036] 表1

[0037]

| X <sup>1</sup>                | X <sup>2</sup>    | X <sup>3</sup>                         |
|-------------------------------|-------------------|----------------------------------------|
| CH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | Ph                                     |
| CH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | 2-CH <sub>3</sub> Ph                   |
| CH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | 2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Ph |
| CH <sub>3</sub>               | NHCH <sub>3</sub> | Ph                                     |
| CH <sub>3</sub>               | NHCH <sub>3</sub> | 2-CH <sub>3</sub> Ph                   |
| CH <sub>3</sub>               | NHCH <sub>3</sub> | 2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Ph |
| CHF <sub>2</sub>              | OCH <sub>3</sub>  | Ph                                     |
| CHF <sub>2</sub>              | OCH <sub>3</sub>  | 2-CH <sub>3</sub> Ph                   |
| CHF <sub>2</sub>              | OCH <sub>3</sub>  | 2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Ph |
| CHF <sub>2</sub>              | NHCH <sub>3</sub> | Ph                                     |
| CHF <sub>2</sub>              | NHCH <sub>3</sub> | 2-CH <sub>3</sub> Ph                   |
| CHF <sub>2</sub>              | NHCH <sub>3</sub> | 2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Ph |
| C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | OCH <sub>3</sub>  | Ph                                     |
| C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | OCH <sub>3</sub>  | 2-CH <sub>3</sub> Ph                   |
| C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | OCH <sub>3</sub>  | 2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Ph |
| C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | NHCH <sub>3</sub> | Ph                                     |
| C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | NHCH <sub>3</sub> | 2-CH <sub>3</sub> Ph                   |
| C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | NHCH <sub>3</sub> | 2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Ph |

[0038] 通式(1)的化合物可具有异构体如互变异构体和立体异构体，其中包括以不对称碳原子为基础的旋光异构体，并且任何异构体能够单独或以按照任何异构体比率的混合物形式包含于和用于本发明中。

[0039] 通式(1)的化合物可以是溶剂化物的形式(例如水合物)并且它能够以溶剂化物的形式用于本发明中。

[0040] 通式(1)的化合物可以是晶体形式和/或非晶形式并且它能够以任何形式用于本发明中。

[0041] 通式(1)的化合物是描述在W095/27,693小册子中的化合物。这些化合物能够例

如通过描述在小册子中的方法来合成。

[0042] 在本发明的防治植物病害的组合物中,化合物I与QoI的重量比典型地是在0.005 : 1至1000 : 1的范围,优选在0.02 : 1-500 : 1的范围。当用作叶面喷雾剂时,该重量比典型地是在0.005 : 1至1000 : 1的范围,优选在0.02 : 1至500 : 1的范围。当用作种子处理剂时,该重量比典型地是在0.02 : 1至500 : 1的范围,优选在0.1 : 1至200 : 1的范围。

[0043] 本发明的防治植物病害的组合物可以是化合物I和QoI的简单混合物。另外,防治植物病害的组合物典型地通过下述方式制造:将化合物I和QoI与惰性载体混合,并且向该混合物中添加表面活性剂和视需要而定的其他助剂以使该混合物能够被配制成油剂,乳液,流动性试剂,可湿性粉剂,粒化可湿性粉剂,粉末剂,粒剂等。以上所述的防治植物病害的组合物能够直接或在添加了其他惰性成分的情况下用作种子处理剂。

[0044] 在本发明的防治植物病害的组合物中,化合物I和QoI的总量典型地在0.1-99wt%的范围、优选0.2-90wt%的范围。

[0045] 用于配方中的固体载体的例子包括细粉末或微粒,例如矿物如高岭粘土、山软木土、膨润土、蒙脱石、酸性白粘土、叶蜡石、滑石、硅藻土和方解石;天然有机材料如玉米穗粉末和胡桃壳粉末;合成有机材料如脲;盐类如碳酸钙和硫酸铵;合成无机材料如合成水合二氧化硅;以及作为液体载体的芳族烃如二甲苯、烷基苯和甲基萘;醇类如2-丙醇、乙二醇、丙二醇和乙二醇单乙醚;酮类如丙酮、环己酮和异佛尔酮;植物油类如大豆油和棉子油;石油脂肪族烃、酯、二甲亚砜、乙腈和水。

[0046] 表面活性剂的例子包括阴离子表面活性剂如烷基硫酸酯盐,烷芳基磺酸盐,琥珀酸二烷基酯磺酸盐,聚氧化乙烯烷基芳基醚磷酸酯盐,木质素磺酸盐和萘磺酸盐甲醛缩聚物;和非离子型表面活性剂如聚氧化乙烯烷基芳基醚,聚氧化乙烯烷基聚氧化丙烯嵌段共聚物和失水山梨糖醇脂肪酸酯以及阳离子表面活性剂如烷基三甲基铵盐。

[0047] 其它配方助剂的例子包括水溶性聚合物如聚乙烯醇和聚乙烯吡咯烷酮,多糖如阿拉伯胶,藻酸及其盐,CMC(羧甲基纤维素),黄原胶,无机材料如硅酸镁铝和氧化铝溶胶,防腐剂,着色剂和稳定剂如PAP(酸式磷酸盐异丙基酯)和BHT。

[0048] 本发明的防治植物病害的组合物对于下列植物病害是有效的。

[0049] 水稻病害:枯萎病(稻瘟梨孢霉),长蠕孢菌叶斑病(宫部旋孢腔菌),鞘枯病(立枯丝核菌),和稻恶苗病(稻恶苗赤霉)。

[0050] 小麦病害:白粉病(禾白粉菌),赤霉丝疫病(禾谷镰孢,燕麦镰孢,大刀镰孢,雪腐病镰孢),锈病(条形柄锈菌,禾柄锈菌,隐匿柄锈菌),粉红雪腐病(Micronectriella nivale),麦类雪腐病(核瑚菌),散黑穗病(小麦散黑粉菌),腥黑粉菌(小麦网腥黑粉菌),眼斑病(小麦基腐病菌),叶斑病(禾生球腔菌),颖枯病(颖枯壳多孢),和黄斑病(偃麦草核腔菌)。

[0051] 大麦病害:白粉病(禾白粉菌),赤霉丝疫病(禾谷镰孢,燕麦镰孢,大刀镰孢,雪腐病镰孢),锈病(条形柄锈菌,禾柄锈菌,大麦柄锈菌),散黑穗病(裸麦黑粉菌),灼病(黑麦喙孢),网斑病(圆核腔菌),斑枯病(禾旋孢霉),叶条纹病(麦类核腔菌),和丝核菌猝倒(立枯丝核菌)。

[0052] 玉米病害:黑穗病(玉米黑粉菌),褐斑病(异纹旋孢霉),铜斑病(高粱胶尾孢),

南方锈病(多堆柄锈菌),灰斑病(玉米尾孢),和丝核菌猝倒(立枯丝核菌)。

[0053] 柑橘病害:黑变病(柑橘间座壳),疮痂病(柑橘痂囊腔菌),青霉腐烂病(指状青霉,意大利青霉),和褐腐病(寄生疫霉,柑橘褐腐病疫霉)。

[0054] 苹果病害:花腐病(苹果链核盘菌),溃疡病(苹果树黑腐皮壳菌),白粉病(苹果白粉病柄球菌),斑点落叶病(苹果斑点落叶病菌),疮痂病(苹果黑星菌),苦腐病(苹果毛盘孢),颈腐病(仙人掌疫霉),大斑点病(苹果双壳菌),环腐病(贝伦格葡萄座腔菌),和紫纹羽病(桑卷旋担子菌)。

[0055] 梨病害:疮痂病(梨黑星菌,梨黑星菌),黑斑病(梨黑斑病菌),锈病(梨胶锈菌),和果腐病(仙人掌疫霉)。

[0056] 桃子病害:褐腐病(果生链核盘菌),疮痂病(嗜果枝孢霉),和拟茎点腐病(拟茎点霉)。

[0057] 葡萄病害:炭疽病(白蔹痂囊腔菌),成熟腐烂病(苹果枯腐病霉),白粉病(葡萄白粉病钩丝壳霉),锈病(葡萄层锈菌),黑腐病(葡萄球座菌),和霜霉病(葡萄霜霉)。

[0058] 柿子病害:炭疽病(柿盘圆孢),和叶斑病(柿尾孢,柿叶球腔菌)。

[0059] 瓠果病害:炭疽病(葫芦科刺盘孢),白粉病(苍耳单丝壳菌),蔓枯病(甜瓜球腔菌),萎蔫病(尖镰孢菌),霜霉病(古巴假霜霉),疫霉腐病(疫霉菌),和猝倒病(腐霉)。

[0060] 番茄病害:早疫病(马铃薯早疫病链格孢),叶霉病(黄枝孢霉),和晚疫病(蔓延疫霉)。

[0061] 茄子病害:褐斑病(茄褐纹拟茎点霉),和白粉病(二孢白粉菌)。

[0062] 十字花科蔬菜的病害:斑点落叶病(日本链格孢),白斑病(芸苔小尾孢),根肿病(芸苔根肿菌),和霜霉病(寄生霜霉)。

[0063] 大葱病害:锈病(葱柄锈菌),和霜霉病(大葱霜霉)。

[0064] 大豆病害:紫斑病(菊池尾孢菌),大豆痂圆孢病(大豆痂囊腔菌),黑点病(大豆黑点病菌),褐斑病(大豆壳针孢),蛙眼叶斑病(大豆尾孢),锈病(豆薯层锈菌),褐色茎腐病(大豆疫霉),和丝核菌猝倒(立枯丝核菌)。

[0065] 菜豆病害:炭疽病(菜豆毛盘孢)。

[0066] 花生病害:叶斑病(球座尾孢),褐色叶斑病(花生尾孢)和南方疫病(齐整小核菌)。

[0067] 豌豆病害:白粉病(豌豆白粉菌),和根腐病(豌豆腐皮镰孢)。

[0068] 马铃薯病害:早疫病(马铃薯早疫病链格孢),晚疫病(蔓延疫霉),红腐病(赤腐疫霉),粉痂病(马铃薯粉痂霉),和黑痣病(立枯丝核菌)。

[0069] 草莓病害:白粉病(葎草单丝壳菌),和炭疽病(苹果枯腐病霉)。

[0070] 茶叶病害:网饼病(网状外担菌),白星病(白色痂囊腔菌),轮斑病(拟盘多毛孢),和炭疽病(茶毛盘孢)。

[0071] 烟草病害:褐斑病(长柄链格孢),白粉病(二孢白粉菌),炭疽病(烟草毛盘孢),霜霉病(烟草霜霉),和黑胫病(烟草疫霉)。

[0072] 油菜籽病害:菌核病(油菜核盘菌),和丝核菌猝倒(立枯丝核菌)。

[0073] 棉花病害:丝核菌猝倒(立枯丝核菌)。

[0074] 糖用甜菜的病害:甜菜叶斑病(甜菜尾孢),叶枯病(立枯丝核菌),根腐病(立枯

丝核菌),和甜菜根腐病(螺壳状丝囊霉)。

[0075] 玫瑰病害:黑斑病(蔷薇双壳菌),白粉病(蔷薇单丝壳菌),和霜霉病(蔷薇霜霉)。

[0076] 菊花和紫菀科植物的病害:霜霉病(莴苣盘霜霉),叶枯病(野菊壳针孢),和白锈病(掘病柄锈菌)。

[0077] 各种群组病害:由腐霉属物种引起的病害(瓜果腐霉,德巴利氏腐霉,禾生腐霉,畸雌腐霉,终极腐霉),灰霉病(灰色葡萄孢),菌核病(油菜核盘菌),和南方疫病(齐整小核菌)。

[0078] 日本萝卜病害:斑点落叶病(甘蓝链格孢)。

[0079] 草坪草病害:草坪银元斑病(核盘菌,*Sclerotinia homeocarpa*),以及褐斑和大斑(立枯丝核菌)。

[0080] 香蕉病害:香蕉叶斑病(裴济球腔菌,香蕉生球壳菌)。

[0081] 向日葵的病害:霜霉病(霍尔斯单轴霉)。

[0082] 由曲霉属物种,青霉属物种,镰孢属物种,赤霉属物种,木霉属物种,串珠根霉属物种,根霉属物种,毛霉属物种,伏革属物种,茎点霉属物种,丝核属物种和色二孢属物种引起的各种植物的种子病害或生长早期的病害。

[0083] 由多粘菌属物种(*polymixa spp.*)或油壶菌属物种等介导的各种植物的病毒性病害。

[0084] 在以上这些之中,预期本发明高效防治的病害的例子包括小麦、玉米、水稻、大豆、棉花、油菜籽、糖用甜菜和草坪草的丝核菌猝倒(立枯丝核菌),种子病害和由镰孢菌属引起的在小麦、大麦、玉米、棉花、大豆、油菜籽和草坪草的早期生长阶段中的病害,水稻的枯萎病(稻瘟梨孢霉)和稻恶苗病(稻恶苗赤霉),小麦的粉红雪腐病(*Micronectriella nivale*)、白粉病(禾白粉菌)、赤霉丝疫病(禾谷镰孢,燕麦镰孢,大刀镰孢,雪腐病镰孢)、眼斑病(小麦基腐病菌)和叶斑病(禾生球腔菌),大麦的白粉病(禾白粉菌)、赤霉丝疫病(禾谷镰孢,燕麦镰孢,大刀镰孢,雪腐病镰孢)、锈病(条形柄锈菌,禾柄锈菌,大麦柄锈菌)、散黑穗病(裸麦黑粉菌)、灼病(黑麦喙孢)和网斑病(圆核腔菌),玉米的黑穗病(玉米黑粉菌),南方锈病(多堆柄锈菌)和灰斑病(玉米尾孢),油菜籽的菌核病(油菜核盘菌),草坪草的褐斑和大斑(立枯丝核菌)和草坪银元斑病(核盘菌,*Sclerotinia homeocarpa*),大豆的锈病(豆薯层锈菌)和紫斑病(菊池尾孢菌),糖用甜菜的甜菜叶斑病(甜菜尾孢)、叶枯病(瓜亡革菌)、根腐病(瓜亡革菌)和甜菜根腐病(螺壳状丝囊霉),马铃薯的黑痣病(立枯丝核菌),和香蕉叶斑病(裴济球腔菌,香蕉生球壳菌)。

[0085] 可以通过将有效量的化合物I和QoI施加至植物病原生物或施加于诸如植物病原生物栖息或可以栖息的植物和土壤之类的地方来防治植物病害。

[0086] 可以通过将有效量的化合物I和QoI施加于植物或生长植物的土壤来防治植物病害。作为施加对象的植物的例子包括植物的叶子,植物的种子,植物的球茎。在这里使用的球茎是指球茎,球根,根茎,块茎,块根和根托。

[0087] 当针对植物病原生物、植物或生长植物的土壤进行施加时,化合物I和QoI可以在相同时期单独施加,但是为了施加的简单,它们典型地被作为本发明的防治植物病害的组合物而施加。

[0088] 本发明的防治方法的例子包括植物叶子的处理,如叶面施药;植物培育地的处理,如土壤处理;种子的处理,如种子消毒和种子涂覆;和球茎如种块的处理。

[0089] 在本发明的防治方法中植物叶子的处理例子包括施加于植物表面的处理,如叶面喷雾和树干喷雾。在移植之前直接吸收至植物的处理方法例子包括浸泡整个植物或根部的方法。通过使用固体载体如矿物粉末所获得的制剂可以粘附于所述根部。

[0090] 在本发明的防治方法中土壤处理方法的例子包括喷雾到土壤上,土壤引入,和化学液体灌注到土壤中(化学液体灌溉,土壤注射,和化学液体的滴灌)。需要处理的地方的例子包括栽植穴,沟槽,栽植穴周围,沟槽周围,培育地的整个表面,土壤和植物之间的部分,根之间的区域,树干下方的区域,主沟槽,生长土壤,育苗箱,育苗盘和种子床。处理时期的例子包括播种之前,播种时,刚播种后,繁育期,沉降种植(settled planting)之前,沉降种植时,和沉降种植后的生长期。在以上土壤处理中,活性成分可以同时施加至植物,或固体肥料如含有活性成分的浆状肥料可以施加至土壤。活性成分也可混合在灌溉液体中,并且其实例包括注入灌溉设备如灌溉管道、灌溉水管和洒水器中,混入沟槽之间的漫灌液体中以及混入水培养介质中。另外,灌溉液体预先与活性成分混合,并且例如通过合适的灌溉方法用于处理,此类方法包括以上所述的灌溉方法和其它方法如喷洒和漫灌。

[0091] 本发明的防治方法中,处理种子或球根的方法的例子包括用本发明的防治植物病害的组合物来处理需要防护植物病害的种子或球茎的方法,并且这些方法的具体例子包括喷雾处理,其中本发明的防治植物病害的组合物的悬浮液被雾化并喷雾到种子表面或球茎表面上;涂抹处理,其中本发明的防治植物病害的组合物的可湿性粉剂、乳液剂或流动性试剂在添加少量的水或没有稀释的情况下被施加于种子或球茎上;浸泡处理,其中种子在本发明的防治植物病害的组合物的溶液剂中浸泡一段时间;涂膜处理;以及微粒涂覆处理。

[0092] 当植物叶子或土壤用化合物I和QoI处理时,用于该处理的化合物I和QoI的量可以根据所要处理的植物的类型,所要防治的病害的类型和发生频率,配方形式,处理时间,气候条件等来改变,但是每10,000m<sup>2</sup>的化合物I和QoI的总量(以下称作活性成分的量)典型地是1至10,000g,优选2至1,000g。

[0093] 该乳液剂、可湿性粉剂和流动性试剂典型地用水稀释,然后为该处理进行喷洒。在这些情况下,化合物I和QoI的总浓度典型地在0.0001-3wt%、优选0.0005-1wt%的范围。粉末剂和微粒剂典型地在没有稀释的情况下用于该处理。

[0094] 在种子的处理中,所要施加的活性成分的量典型地在每1kg种子为0.001-10g、优选0.01-3g的范围。

[0095] 本发明的防治方法能够用于农业土地,如田地、水田、草坪和果园或用于非农业土地。

[0096] 本发明可以用于在栽植下列“植物”等的农业土地中防治病害,而不会不利地影响该植物等。

[0097] 农作物的例子如下:

[0098] 农作物:玉米,水稻,小麦,大麦,黑麦,燕麦,高粱,棉花,大豆,花生,荞麦,甜菜,油菜籽,向日葵,甘蔗,烟草,等;

[0099] 蔬菜:茄科蔬菜(茄子,番茄,西班牙甜椒,胡椒,马铃薯,等),葫芦科蔬菜(瓠果,南瓜,西葫芦,西瓜,甜瓜,倭瓜,等),十字花科蔬菜(日本萝卜,白芸菁,山葵,撇蓝,大

白菜,卷心菜,芥菜,西兰花,花椰菜,等),紫菀科蔬菜(牛蒡,筒篙,洋蓟,莴苣,等),百合科蔬菜(青葱,洋葱,大蒜,和芦笋),伞形科蔬菜(ammiaceous vegetables)(胡萝卜,欧芹,芹菜,欧洲防风,等),藜科蔬菜(菠菜,厚皮菜,等),薄荷科蔬菜(白苏子,薄荷,罗勒,等),草莓,甘薯,日本薯蓣,芋头,等;

[0100] 花卉:

[0101] 叶子植物;

[0102] 草皮草;

[0103] 水果:仁果类(苹果,梨子,日本梨,木瓜,榅桲,等),有果核的肉质果(桃子,李子,油桃,梅,樱桃果,杏,洋李,等),柑橘类(温州蜜柑,橙,柠檬,橘柚,柚子,等),坚果类(栗子,胡桃,榛子,杏仁,阿月浑子,腰果,夏威夷坚果,等),浆果(蓝莓,红莓,草莓,树莓,等),葡萄,柿子,橄榄,李,香蕉,咖啡,海枣,椰子,等;和

[0104] 除果树之外的树;茶叶,桑树,有花植物,路旁树(白蜡树,桦树,山茱萸,桉树,银杏,紫丁香,枫,栎,白杨,南欧紫荆,枫香树,法国梧桐,榉树,日本香柏,冷杉木,铁杉,杜松,松属,云杉属,和紫杉),等。

[0105] 特别地,本发明的防治方法能够用于在栽植玉米,水稻,小麦,大麦,高粱,棉花,大豆,甜菜,油菜籽,草皮草或马铃薯的农业土地中防治病害。

[0106] 上述“植物”包括这样的植物,已经由传统的繁育方法或基因工程技术赋予了它们耐受HPPD抑制剂如异噁唑草酮,ALS抑制剂如咪草烟或甲基噁吩磺隆,EPSP合成酶抑制剂如草甘膦,谷氨酰胺合成酶抑制剂如草胺膦,乙酰辅酶A羧化酶抑制剂如烯禾定,以及除草剂如溴苯腈、麦草畏、2,4-D等的性能。

[0107] 已经由传统的繁育方法赋予耐受性的“植物”的例子包括耐受咪唑啉酮ALS抑制性除草剂如咪草烟的油菜,小麦,向日葵和水稻,它们早已可通过Clearfield(注册商标)的产品名称来商购。类似地,还有通过传统的繁育方法赋予耐受磺酰脲ALS抑制性除草剂如甲基噁吩磺隆的性能的大豆,它早已可通过STS大豆的产品名称来商购。类似地,已经通过传统繁育方法赋予耐受乙酰辅酶A羧化酶抑制剂如三酮肟或芳氧基苯氧基丙酸除草剂的性能的例子包括SR玉米。已经赋予耐受乙酰辅酶A羧化酶抑制剂的性能的植物已描述在美国科学院论文集(Proc. Natl. Acad. Sci. USA), vol. 87, pp. 7175-7179(1990)。抗乙酰辅酶A羧化酶抑制剂的乙酰辅酶A羧化酶的变型已报道于Weed Science, 53卷, 第728-746页(2005)中,并且抗乙酰辅酶A羧化酶抑制剂的植物能够通过利用基因工程技术将该乙酰辅酶A羧化酶变型的基因引入到植物中,或通过将赋予耐受性的变型引入到植物乙酰辅酶A羧化酶中来产生。此外,耐受乙酰辅酶A羧化酶抑制剂或ALS抑制剂等的植物能够通过将定点氨基酸置换变型引入到乙酰辅酶A羧化酶基因中或通过核酸(已经在其中引入了代表Chimeroplasty Technique(Gura T. 1999. Repairing the Genome's Spelling Mistakes. Science 285 :316-318)的碱基置换变型)的引入将植物的ALS基因引入到植物细胞中来产生。

[0108] 已经由基因工程技术赋予耐受性的植物的例子包括耐草甘膦的玉米、大豆、棉花、油菜、糖用甜菜,它(们)早已可通过RoundupReady(注册商标)、AgrisureGT等的产品名称来购买。类似地,还有已经由基因工程技术赋予耐草胺膦性能的玉米、大豆、棉花和油菜,它(们)早已可通过LibertyLink(注册商标)的产品名称来购买。由基因工程技术赋予

耐溴苯腈性能的棉花同样地早已可通过 BXN 的产品名称来购买。

[0109] 上述“植物”包括通过使用该基因工程技术制造的基因工程农作物,它们能够合成在杆菌属中已知的选择性毒素。

[0110] 在此类基因工程农作物中表达的毒素的例子包括:从蜡状芽孢杆菌 (*Bacillus cereus*) 或乳状芽孢杆菌 (*Bacillus popilliae*) 获得的杀虫蛋白质;δ - 内毒素如 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1 或 Cry9C,它们从苏云金芽孢杆菌 (*Bacillus thuringiensis*) 获得;杀虫蛋白质如 VIP1、VIP2、VIP3 或 VIP3A;从线虫获得的杀虫蛋白质;由动物产生的毒素,如蝎毒素,蜘蛛毒素,蜜蜂毒素,或昆虫 - 特异性神经毒素;霉菌毒素 (mold fungi toxins);植物外源凝集素;凝集素;蛋白酶抑制剂如胰蛋白酶抑制剂,丝氨酸蛋白酶抑制剂,马铃薯块茎特异蛋白 (patatin),抑半胱氨酸蛋白酶蛋白,或木瓜蛋白酶抑制剂;核糖体灭活蛋白质 (RIP) 如甜菜碱、玉米 - RIP、相思豆毒蛋白、免疫毒素 (luffin)、皂草毒蛋白 (saporin) 或 briodin;甾类代谢酶如 3- 羟基类固醇氧化酶,蜕化类固醇 (ecdysteroid) - UDP- 葡糖基转移酶,或胆固醇氧化酶;蜕皮激素抑制剂;HMG-CoA 还原酶;离子通道抑制剂如钠通道抑制剂或钙通道抑制剂;保幼激素酯酶;利尿激素受体;芪合成酶;联苄合成酶;壳多糖酶;和葡聚糖酶。

[0111] 在此类基因工程农作物中表达的毒素还包括:δ - 内毒素蛋白质的杂化毒素,如 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1、Cry9C、Cry34Ab 或 Cry35Ab 以及杀虫蛋白质如 VIP1、VIP2、VIP3 或 VIP3A;部分缺失 (partially deleted) 的毒素;和改性毒素。此类杂化毒素是使用基因工程技术通过此类蛋白质的不同功能域的新的组合制造的。作为部分缺失的毒素,包括氨基酸序列的一部分的缺失的 Cry1Ab 是已知的。改性毒素是通过天然毒素的一个或多个氨基酸的置换而制造的。

[0112] 此类毒素的例子以及能够合成此类毒素的基因工程植物已描述在 EP-A-0 374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878, WO 03/052073 等中。

[0113] 基因工程植物中所含的毒素能够为植物赋予特别是抵抗属于鞘翅目,半翅目,双翅目,鳞翅目和线虫的虫害的能力。

[0114] 包含一种或多种杀虫性抗虫基因且表达一种或多种毒素的基因工程植物早已已知,并且此类基因工程植物中的一些早已有销售。此类基因工程植物的例子包括 YieldGard (注册商标) (表达 Cry1Ab 毒素的玉米品种), YieldGard Rootworm (注册商标) (表达 Cry3Bb1 毒素的玉米品种), YieldGard Plus (注册商标) (表达 Cry1Ab 和 Cry3Bb1 毒素的玉米品种), Herculex I (注册商标) (表达 phosphinotricine N- 乙酰转移酶 (PAT) 以便赋予耐 Cry1Fa2 毒素和草胺膦的性能的玉米品种), NuCOTN33B (注册商标) (表达 Cry1Ac 毒素的棉花品种), Bollgard I (注册商标) (表达 Cry1Ac 毒素的棉花品种), Bollgard II (注册商标) (表达 Cry1Ac 和 Cry2Ab 毒素的棉花品种), VIPCOT (注册商标) (表达 VIP 毒素的棉花品种), NewLeaf (注册商标) (表达 Cry3A 毒素的马铃薯品种), NatureGard (注册商标) Agrisure (注册商标) GT Advantage (GA21 耐草甘膦特性), Agrisure (注册商标) CB Advantage (Bt11 玉米螟 (CB) 特性), 和 Protecta (注册商标)。

[0115] 上述“植物”也包括使用基因工程技术所制造的农作物,它能够产生具有选择作用的抗病物质。

[0116] PR 蛋白质和类似物已知是此类抗病物质 (PRP, EP-A-0 392 225)。该抗病物质和

产生它们的基因工程农作物已描述在 EP-A-0 392 225, WO 95/33818, EP-A-0 353 191 等中。

[0117] 在基因工程农作物中表达的此类抗病物质的例子包括：离子通道抑制剂如钠通道抑制剂或钙通道抑制剂 (KP1, KP4 和 KP6 毒素等, 它们通过病毒产生, 是已知的) ; 茂合成酶; 联苄合成酶; 壳多糖酶; 葡聚糖酶; PR 蛋白质; 和由微生物产生的抗病物质, 如肽抗生素, 具有杂环的抗生素, 与抗植物病害有关的蛋白质因子 (它被称作抗植物病害基因并且已描述在 WO 03/000906 中)。这些抗病物质和产生此类物质的基因工程植物已描述在 EP-A-0392225, WO95/33818, EP-A-0353191 等中。

[0118] 以上提到的“植物”包括已经通过基因工程技术赋予理想特征, 如在油料成分上改进的特征, 或赋予提高氨基酸含量的特征的植物。它的例子包括 VISTIVE(注册商标) 低亚麻酸大豆 (减少的亚麻酸含量) 或高赖氨酸 (高油) 玉米 (提高赖氨酸含量或含油量的玉米)。

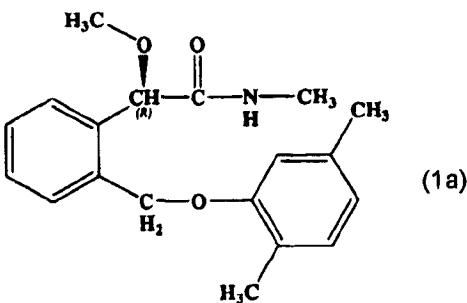
[0119] 特性叠加品种也包括在内, 其中组合了多个的理想特征如以上所提及的传统除草特性或耐除草剂的基因, 抗害虫基因, 产生抗病物质的基因, 在油料成分上改进的特征或高氨基酸含量的特征。

#### [0120] 实施例

[0121] 尽管本发明在下面利用配方实施例、种子处理实施例和试验实施例来更具体地进行说明, 但是本发明不局限于下列实施例。在下面的实施例中, 除非另外具体说明, 否则份表示重量份。

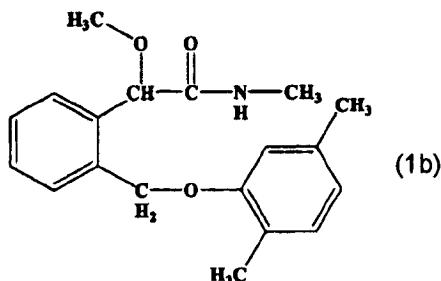
[0122] 化合物 (1a) 是由通式 (1) 表示的化合物, 其中 X<sup>1</sup> 是甲基, X<sup>2</sup> 是甲基氨基, 和 X<sup>3</sup> 是 2,5- 二甲基苯基, 并且该化合物具有根据 Cahn-Ingold-Prelog 顺序规则的 R 型空间结构, 并且由下面的通式 (1a) 表示。

[0123]



[0124] 化合物 (1b) 是由通式 (1) 表示的化合物, 其中 X<sup>1</sup> 是甲基, X<sup>2</sup> 是甲基氨基, 和 X<sup>3</sup> 是 2,5- 二甲基苯基, 并且该化合物是消旋体并且由下面的通式 (1b) 表示。

[0125]



[0126] 配方实施例 1 :

[0127] 2.5 份的氟嘧菌酯,1.25 份的化合物 I,14 份的聚氧化乙烯苯乙烯基苯基醚,6 份的十二烷基苯磺酸钙和 76.25 份的二甲苯完全混合,由此获得乳液。

[0128] 配方实施例 2

[0129] 五(5)份的嘧菌酯,5 份的化合物 I,35 份的由白碳 (white carbon) 和聚氧化乙烯烷基醚硫酸铵盐组成的混合物 (重量比 1 : 1) 和 55 份的水进行混合,然后混合物根据湿磨方法进行细磨,由此获得流动性制剂。

[0130] 配方实施例 3

[0131] 五(5)份的肟菌酯,10 份的化合物 I,1.5 份的失水山梨糖醇三油酸酯和 28.5 份的含有 2 份聚乙烯醇的水溶液进行混合,混合物根据湿磨方法进行细磨。此后,将 45 份的含有 0.05 份黄原胶和 0.1 份硅酸镁铝的水溶液添加到所得混合物中,然后进一步在其中添加 10 份的丙二醇。所获得的混合物通过搅拌来共混,由此获得流动性制剂。

[0132] 配方实施例 4

[0133] 五(5)份的化合物 (1a) 或化合物 (1b),40 份的化合物 I,5 份的丙二醇 (由 Nacalai Tesque 制造),5 份的 SoprophorFLK (由 Rhodia Nikka 制造),0.2 份的反式 C 乳液 (anti-form C emulsion) (由 Dow Corning 制造),0.3 份的 proxel GXL (由 Arch Chemicals 制造) 和 49.5 份的离子交换水进行混合,由此获得本体浆料。将 150 份的玻璃珠 (直径 = 1mm) 投入到 100 份的浆料中,然后将浆料研磨 2 小时,同时用冷却水加以冷却。在研磨后,所得产物进行过滤以除去玻璃珠,获得各自的流动性制剂。

[0134] 配方实施例 5

[0135] 五十(50)份的化合物 I,0.5 份的吡唑醚菌酯,38.5 份的 NN 高岭粘土 (由 Takehara Chemical Industrial 制造),10 份的 MorwetD425 和 1.5 份的 MorwerEFW (由 Akzo Nobel Corp. 制造) 进行混合而获得 AI 预混物。该预混物用喷射磨研磨,由此获得粉末制剂。

[0136] 配方实施例 6

[0137] 四(4)份的啶氧菌酯,1 份的化合物 I,1 份的合成水合二氧化硅,2 份的木素磺酸钙,30 份的膨润土和 62 份的高岭粘土完全地研磨和混合,向所得混合物中添加水并完全捏合,然后进行造粒和干燥而获得微粒制剂。

[0138] 配方实施例 7

[0139] 两(2)份的肟醚菌胺,1 份的化合物 I,87 份的高岭粘土和 10 份的滑石完全地研磨和混合,由此获得粉末制剂。

[0140] 配方实施例 8

[0141] 两(2)份的烯肟菌酯,20 份的化合物 I,3 份的木素磺酸钙,2 份的十二烷基硫酸钠和 73 份的合成水合二氧化硅进行完全研磨和混合,由此获得可湿性粉剂。

[0142] 种子处理实施例 1

[0143] 使用旋转式种子处理机 (种子拌药器,由 Hans-Ulrich Hege GmbH 制造),将配方实施例 1 中制得的乳液以每 100kg 干燥高粱种子为 500ml 的量用于涂抹处理,从而获得经处理的种子。

[0144] 种子处理实施例 2

[0145] 使用旋转式种子处理机 (种子拌药器,由 Hans-Ulrich Hege GmbH 制造),将配方实施例 2 中制得的流动性制剂以每 10kg 的干燥油菜籽为 50ml 的量用于涂抹处理,从而

获得经处理的种子。

[0146] 种子处理实施例 3

[0147] 使用旋转式种子处理机（种子拌药器，由 Hans-Ulrich Hege GmbH 制造），将配方实施例 3 中制得的流动性配制剂以每 10kg 的干燥玉米种子为 40ml 的量用于涂抹处理，从而获得经处理的种子。

[0148] 种子处理实施例 4

[0149] 五 (5) 份的配方实施例 4 中制得的流动性配制剂，5 份的颜料 BPD6135（由 Sun Chemical 制造）和 35 份的水进行混合，制备混合物。使用旋转式种子处理机（种子拌药器，由 Hans-Ulrich Hege GmbH 制造），将所述混合物以每 10kg 的干燥棉籽为 60ml 的量用于涂抹处理，从而获得经处理的种子。

[0150] 种子处理实施例 5

[0151] 将配方实施例 5 中制得的粉末剂以每 10kg 的干燥玉米种子为 50g 的量用于粉末涂覆处理，从而获得经处理的种子。

[0152] 种子处理实施例 6

[0153] 将配方实施例 7 中制得的粉末剂以每 100kg 的干燥稻谷种子为 40kg 的量用于粉末涂覆处理，从而获得经处理的种子。

[0154] 种子处理实施例 7

[0155] 使用旋转式种子处理机（种子拌药器，由 Hans-Ulrich Hege GmbH 制造），将配方实施例 2 中制得的流动性配制剂以每 10kg 的干燥大豆种子为 50ml 的量用于涂抹处理，从而获得经处理的种子。

[0156] 种子处理实施例 8

[0157] 使用旋转式种子处理机（种子拌药器，由 Hans-Ulrich Hege GmbH 制造），将配方实施例 3 中制得的流动性配制剂以每 10kg 的干燥小麦种子为 50ml 的量用于涂抹处理，从而获得经处理的种子。

[0158] 种子处理实施例 9

[0159] 五 (5) 份的配方实施例 4 中制备的流动性配制剂，5 份的颜料 BPD6135（由 Sun Chemical 制造）和 35 份的水进行混合，使用旋转式种子处理机（种子拌药器，由 Hans-Ulrich Hege GmbH 制造），将所得混合物以每 10kg 的马铃薯块茎片为 70ml 的量用于涂抹处理，从而获得经处理的种子。

[0160] 种子处理实施例 10

[0161] 五 (5) 份的配方实施例 4 中制备的流动性配制剂，5 份的颜料 BPD6135（由 Sun Chemical 制造）和 35 份的水进行混合，使用旋转式种子处理机（种子拌药器，由 Hans-Ulrich Hege GmbH 制造），将所得混合物以每 10kg 的向日葵籽为 70ml 的量用于涂抹处理，从而获得经处理的种子。

[0162] 种子处理实施例 11

[0163] 将配方实施例 5 中制得的粉末剂以每 10kg 的干燥的糖用甜菜种子为 40g 的量用于粉末涂覆处理，从而获得经处理的种子。

[0164] 试验实施例 1

[0165] 分别制备化合物 I 的 DMSO 溶液和化合物 (1b) 的 DMSO 溶液。这些溶液进行混合

来制备含有预定浓度的化合物 I 和化合物 (1b) 的 DMSO 溶液。十 (10)  $\mu\text{L}$  的 DMSO 溶液和 10g 的豌豆种子 (*Pisum sativum L*) 通过在 50ml 锥形管中振荡来混合, 然后静置一夜以制备经处理的种子。塑料罐中加入沙质土壤并且将经处理的种子播种在土壤上, 然后用已经与豌豆腐皮镰孢的麦麸培养物混合的沙质土壤来覆盖。播种的种子用水浇灌, 然后在温室内于 20–24°C 下培养。在幼苗出现后, 将豌豆腐皮镰孢的孢子悬浮液 ( $1 \times 10^6/\text{mL}$ ) 浸湿幼苗的根, 然后幼苗进一步培养。在 16 天后, 检查豌豆根腐病的发生, 并由方程式 1 计算发病率。

[0166] 作为对比, 制备含有预定浓度的化合物 (1b) 的 DMSO 溶液并进行相同的试验, 并测定发病率。

[0167] 为了计算防治值, 进行相同的试验, 其中植物没有用试验化合物处理, 然后测定发病率。

[0168] 以所测得的发病率为基础, 由方程式 2 计算防治值。

[0169] 结果示于表 2 中。

[0170] “方程式 1”

[0171] 发病率 = ( 观察到病害发生的幼苗的数量 )  $\times 100 / ( \text{播种种子的总数} )$

[0172] “方程式 2”

[0173] 防治值 =  $100 \times (A - B) / A$

[0174] A : 没有用试验化合物处理的植物的发病率

[0175] B : 用至少一种试验化合物处理的植物的发病率

[0176] 表 2

| 试验化合物                              |                                  | 防治值 |
|------------------------------------|----------------------------------|-----|
| 化合物(1b)<br>活性成分剂量<br>(g/100 kg 种子) | 化合物 I<br>活性成分剂量<br>(g/100 kg 种子) |     |
| 5                                  | 10                               | 82  |
| 1                                  | 10                               | 82  |
| 5                                  | 0                                | 64  |
| 1                                  | 0                                | 64  |

[0178] 试验实施例 2

[0179] 在塑料罐中添加沙质土壤, 然后将小麦 (SHIROGANEKOMUGI) 的种子播种在土壤上, 随后在温室内培养 10 天。通过将 10 份的化合物 I, 35 份的由白碳和聚氧化乙烯烷基醚硫酸铵盐 (1 : 1 的重量比) 组成的混合物和 55 份的水混合, 随后研磨所得混合物来制备化合物 I 的可湿性粉剂。化合物 (1b) 的可湿性粉剂是通过将 10 份的化合物 (1b), 35 份的由白碳和聚氧化乙烯烷基醚硫酸铵盐 (1 : 1 的重量比) 组成的混合物和 55 份的水混合, 随后研磨所得混合物来制备的。所制备的可湿性粉剂中的每一种分别用水稀释, 随后混合在一起以制备含有预定浓度的化合物 I 和化合物 (1b) 的混合溶液。混合溶液被喷雾在小麦的叶子上, 以使溶液充分地附着于小麦叶子的表面上。在喷雾和随后的空气干燥之后, 将

与滑石混合的小麦叶锈病孢子喷雾到小麦叶子的表面上。在高湿度下于 23℃ 下静置一夜以及随后在人工气候实验室中于 23℃ 下培养 8 天之后, 检查小麦叶子的叶面积和损伤面积, 并由方程式 3 计算发病率。

[0180] 作为对比, 化合物 (1b) 的可湿性粉剂用水稀释以制备含有预定浓度的化合物 (1b) 的溶液并且进行相同的试验以测定发病率。

[0181] 为了计算防治值, 进行相同的试验, 其中植物没有用试验化合物处理, 然后测定发病率。

[0182] 以所测得的发病率为基础, 由方程式 2 计算防治值。

[0183] 结果示于表 3 中。

[0184] “方程式 3”

[0185] 发病率 = (受试叶子的损伤面积) × 100 / (受试叶子的叶面积)

[0186] 表 3

| [0187] | 试验化合物                  |                      | 防治值 |
|--------|------------------------|----------------------|-----|
|        | 化合物(1b)<br>活性成分浓度(ppm) | 化合物 I<br>活性成分浓度(ppm) |     |
|        |                        |                      |     |
|        | 20                     | 200                  | 92  |
|        | 10                     | 200                  | 83  |
|        | 20                     | 0                    | 81  |
|        | 10                     | 0                    | 50  |

[0188] 试验实施例 3

[0189] 分别制备化合物 I 的 DMSO 溶液, 化合物 (1b) 的 DMSO 溶液, 苯氧菌酯的 DMSO 溶液, 吡唑醚菌酯的 DMSO 溶液, 育菌酯的 DMSO 溶液和吡菌苯威的 DMSO 溶液。这些溶液进行混合来制备含有预定浓度的化合物 I 和化合物 (1b) 的 DMSO 溶液, 含有预定浓度的化合物 I 和苯氧菌酯的 DMSO 溶液, 含有预定浓度的化合物 I 和吡唑醚菌酯的 DMSO 溶液, 含有预定浓度的化合物 I 和育菌酯的 DMSO 溶液和含有预定浓度的化合物 I 和吡菌苯威的 DMSO 溶液。二十五 (25)  $\mu\text{L}$  的每一种 DMSO 溶液和 10g 的玉米种子 (Pioneer) 通过在 50mL 锥形管中振荡来混合, 然后静置一夜以制备经处理的种子。塑料罐中加入沙质土壤并且将经处理的种子播种在土壤上, 然后用已经与禾谷镰孢的麦麸培养物混合的沙质土壤来覆盖。播种的种子用水浇灌, 然后在温室中于 15℃ 下培养 15 天。检查出现的幼苗的数量, 然后由方程式 4 计算发病率。

[0190] 作为对比, 分别制备含有预定浓度的化合物 (1b)、苯氧菌酯、吡唑醚菌酯、育菌酯或吡菌苯威各自的 DMSO 溶液并进行相同的试验, 并测定发病率。

[0191] 为了计算防治值, 进行相同的试验, 其中植物没有用试验化合物处理, 然后测定发病率。

[0192] 以所测得的发病率为基础, 由方程式 2 计算防治值。

[0193] 结果示于表 4 中。

[0194] “方程式 4”

[0195] 发病率 =  $100 \times \{1 - (\text{出现幼苗的数量}) / (\text{播种种子的总数})\}$

[0196] 表 4

| 试验化合物<br>活性成分剂量<br>(g/100 kg 种子) | 防治值 |
|----------------------------------|-----|
| 化合物(1b) 10g + 化合物 I 50g          | 100 |
| 苯氧菌酯 10g + 化合物 I 50g             | 83  |
| 吡唑醚菌酯 10g + 化合物 I 50g            | 100 |
| 0197 肠菌酯 10g + 化合物 I 50g         | 100 |
| 吡菌苯威 10g + 化合物 I 50g             | 100 |
| 化合物(1b) 10g                      | 83  |
| 苯氧菌酯 10g                         | 67  |
| 吡唑醚菌酯 10g                        | 83  |
| 肠菌酯 10g                          | 83  |
| 吡菌苯威 10g                         | 83  |

[0198] 试验实施例 4

[0199] 分别制备化合物 I 的 DMSO 溶液和嘧菌酯的 DMSO 溶液。这些溶液进行混合以制备含有预定浓度的化合物 I 和嘧菌酯的 DMSO 溶液。二十五 (25)  $\mu\text{L}$  的每一种 DMSO 溶液和 10g 的玉米种子 (Pioneer) 通过在 50mL 锥形管中振荡来混合, 然后静置一夜制备经处理的种子。塑料罐中加入沙质土壤并且将经处理的种子播种在土壤上, 然后用已经与燕麦镰孢的麦麸培养物混合的沙质土壤来覆盖。播种的种子用水浇灌, 然后在温室中于 15°C 下培养 15 天。检查出现的幼苗的数量, 然后由方程式 4 计算发病率。

[0200] 作为对比, 制备含有预定浓度的嘧菌酯的 DMSO 溶液并进行相同的试验, 然后测定发病率。

[0201] 为了计算防治值, 进行相同的试验, 其中植物没有用试验化合物处理, 然后测定发病率。

[0202] 以所测得的发病率为基础, 由方程式 2 计算防治值。

[0203] 结果示于表 5 中。

[0204] 表 5

| 试验化合物<br>活性成分剂量<br>(g/100 kg 种子) | 防治值 |
|----------------------------------|-----|
| 密菌酯 10g + 化合物 I 10g              | 83  |
| 密菌酯 10g                          | 67  |

[0206] 产业实用性

[0207] 根据本发明，可以提供具有高活性的防治植物病害的组合物，和有效防治植物病害的方法。