



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 103648273 B

(45) 授权公告日 2015. 09. 30

(21) 申请号 201280013707. 5

(22) 申请日 2012. 03. 12

(30) 优先权数据

11158497. 5 2011. 03. 16 EP

61/468805 2011. 03. 29 US

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2013. 09. 16

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/EP2012/054298 2012. 03. 12

(87) PCT国际申请的公布数据

W02012/123426 EN 2012. 09. 20

(73) 专利权人 拜耳知识产权有限责任公司

地址 德国蒙海姆

(72) 发明人 R·迈斯纳 T·塞茨

G·拉布尔代特 S·塔福罗

(74) 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公

司 72001

代理人 赵苏林 万雪松

(51) Int. Cl.

A01N 3/00(2006. 01)

A01N 43/90(2006. 01)

A01P 3/00(2006. 01)

A23B 7/154(2006. 01)

(56) 对比文件

CN 102186352 A, 2011. 09. 14,

US 3364229 A, 1968. 01. 16,

审查员 高宁馨

权利要求书5页 说明书15页

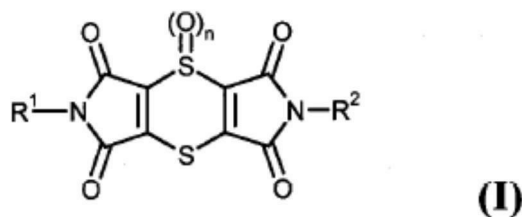
(54) 发明名称

二硫杂环己二烯四甲酰亚胺用于保护采收的产品抵抗植物病原性真菌的用途

(57) 摘要

本发明涉及用于保护采收的水果、切花或蔬菜抵抗由于某些存储病害或者在存储条件下表现出的病害所导致的腐烂的方法,所述水果、切花或蔬菜已经在采收前用式(I)的二硫杂环己二烯四甲酰亚胺进行过处理。尤其是,本发明涉及式(I)的二硫杂环己二烯四甲酰亚胺在采收之前用于保护采收的水果、切花或蔬菜抵抗植物病原性真菌的应用。

1. 至少一种式 (I) 的二硫杂环己二烯四甲酰亚胺或其农业化学品可接受的盐用于保护采收的水果、切花或蔬菜抵抗植物病原性真菌的用途,



其中

$R^1$ 和  $R^2$ 相同或不同并且代表氢,或者  $C_{1-8}$ -烷基,

$n$ 代表 0 或 1,

其特征在于所述式 (I) 的二硫杂环己二烯四甲酰亚胺在采收前施用。

2. 根据权利要求 1 的用途,其特征在于

$R^1$ 和  $R^2$ 相同或不同并且代表氢或代表  $C_{1-6}$ -烷基,

$n$ 代表 0 或 1。

3. 根据权利要求 1 的用途,其特征在于

$R^1$ 和  $R^2$ 相同或不同并且代表氢,或代表  $C_{1-4}$ -烷基,

$n$ 代表 0 或 1。

4. 根据权利要求 1 的用途,其特征在于  $R^1$ 和  $R^2$ 同时代表甲基。

5. 根据权利要求 1 的用途,其特征在于所述真菌选自:炭疽菌属;镰刀菌属;轮枝菌属;黑孢霉属;葡萄孢属;地丝菌属;拟茎点霉属;色二孢属;链格孢属;疫霉属;壳针孢属;毛霉属;链核盘菌属;黑星菌属;根霉属;小丛壳菌属;核盘菌属;长喙菌属;青霉属;盘长孢属;壳蛇孢属;柱孢属;匍柄霉属;星裂壳孢属;根串珠霉属;曲霉属;丛赤壳属;无柄盘菌属。

6. 根据权利要求 5 的用途,其特征在于:

所述炭疽菌属真菌选自香蕉炭疽菌、胶孢炭疽菌、球炭疽菌;

所述镰刀菌属真菌选自半裸镰刀菌、串珠镰刀菌、腐皮镰刀菌、尖孢镰刀菌;

所述轮枝菌属真菌选自可可轮枝孢菌;

所述葡萄孢属真菌选自灰葡萄孢;

所述地丝菌属真菌选自白地霉;

所述拟茎点霉属真菌选自纳塔尔拟茎点霉;

所述色二孢属真菌选自柑桔色二孢;

所述链格孢属选自柑橘链格孢、互隔交链孢菌;

所述疫霉属真菌选自柑橘褐腐疫霉、草莓疫霉、恶疫霉、烟草疫霉;

所述壳针孢属真菌选自 *Septoria depressa*;

所述毛霉属真菌选自梨形毛霉;

所述链核盘菌属真菌选自果生链核盘菌、核果链核盘菌;

所述黑星菌属真菌选自苹果黑星病菌、梨黑星病菌;

所述根霉属真菌选自匍枝根霉、米根霉;

所述小丛壳菌属真菌选自围小丛壳菌;

所述核盘菌属真菌选自果生核盘菌；  
所述长喙菌属真菌选自奇异长喙壳；  
所述青霉属真菌选自绳状青霉、扩展青霉、指状青霉、意大利青霉；  
所述盘长孢属真菌选自白盘长孢、*Gloeosporium perennans*、果生盘长孢、*Gloeosporium singulata*；  
所述壳蛇孢属真菌选自 *Phlyctaena vagabunda*；  
所述柱孢属真菌选自苹果柱孢；  
所述匍柄霉属真菌选自黄花菜匍柄霉；  
所述星裂壳孢属真菌选自 *Phacydiopycnis malirum*；  
所述根串珠霉属真菌选自奇异根串珠霉；  
所述曲霉属真菌选自黑曲霉、炭黑曲霉；  
所述从赤壳属真菌选自干癌丛赤壳。

7. 根据权利要求 1 的用途,其特征在于所述水果和蔬菜选自:谷类;甜菜;梨果和核果和浆果;豆科植物;油脂植物;葫芦科;纤维植物;柑橘类水果;热带水果;蔬菜;十字花科;月桂类植物;或者橡胶植物以及观赏植物、灌木、落叶树和常绿树。

8. 根据权利要求 1 的用途,其特征在于所述水果和蔬菜选自:玉米、烟草、坚果、咖啡、甘蔗、茶叶、葡萄藤、蛇麻草。

9. 根据权利要求 7 的用途,其特征在于:

所述谷类选自小麦、大麦、黑麦、燕麦、水稻、高粱;

所述甜菜选自糖用甜菜和饲料甜菜;

所述梨果和核果和浆果选自苹果、梨、李子、桃、杏、樱桃、草莓、树莓和黑莓;

所述豆科植物选自菜豆、小扁豆、豌豆、黄豆;

所述油脂植物选自油菜、芥菜、罌粟、橄榄、向日葵、椰子、蓖麻、可可、花生;

所述葫芦科选自南瓜、小黄瓜、甜瓜、黄瓜、笋瓜;

所述纤维植物选自棉花、亚麻、大麻、黄麻;

所述柑橘类水果选自橙子、柠檬、葡萄柚、柑橘;

所述热带水果选自番木瓜、西番莲、芒果、杨桃、菠萝、香蕉;

所述蔬菜选自菠菜,莴苣,芦笋;

所述十字花科选自卷心菜和芜菁,胡萝卜,洋葱,番茄,马铃薯,辣椒和甜椒;

所述月桂类植物选自鳄梨、肉桂、樟脑树;

所述观赏植物选自切花、玫瑰、非洲菊和花球茎;

所述常绿树选自松柏类。

10. 根据权利要求 1 的用途,其特征在于所述水果、切花或蔬菜在采收前使用至少一种根据权利要求 1、2、3 或 4 的式 (I) 的二硫杂环己二烯四甲酰亚胺处理 1 周至 4 周。

11. 根据权利要求 10 的用途,其特征在于所述水果、切花或蔬菜在采收前使用至少一种根据权利要求 1、2、3 或 4 的式 (I) 的二硫杂环己二烯四甲酰亚胺处理 2 周至 3 周。

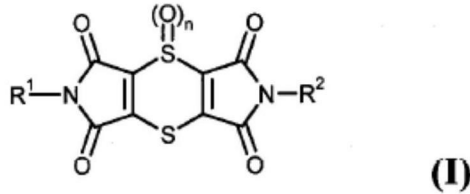
12. 根据权利要求 1-11 中任一项的用途,其特征在于将所述水果、切花或蔬菜保护至少 21 天的时间段。

13. 根据权利要求 12 的用途,其特征在于将所述水果、切花或蔬菜保护 21 至 360 天的

时间段。

14. 根据权利要求 12 的用途,其特征在于将所述水果、切花或蔬菜保护 45 至 250 天的时间段。

15. 通过在采收前使用至少一种式 (I) 的二硫杂环己二烯四甲酰亚胺或其农业化学品可接受的盐处理水果、切花或蔬菜从而抵抗存储病害的方法,



其中

$R^1$  和  $R^2$  相同或不同并且代表氢,或者  $C_1-C_8$ -烷基;

$n$  代表 0 或 1。

16. 根据权利要求 15 的方法,其特征在于:

$R^1$  和  $R^2$  相同或不同并且代表氢或代表  $C_1-C_6$ -烷基,

$n$  代表 0 或 1。

17. 根据权利要求 15 的方法,其特征在于:

$R^1$  和  $R^2$  相同或不同并且代表氢,或代表  $C_1-C_4$ -烷基,

$n$  代表 0 或 1。

18. 根据权利要求 15 的方法,其特征在于所述病害由选自如下的真菌引起:炭疽菌属;镰刀菌属;轮枝菌属;黑孢霉属;葡萄孢属;地丝菌属;拟茎点霉属;色二孢属;链格孢属;疫霉属;壳针孢属;毛霉属;链核盘菌属;黑星菌属;根霉属;小从壳菌属;核盘菌属;长喙菌属;青霉属;盘长孢属;壳蛇孢属;柱孢属;匍柄霉属;星裂壳孢属;根串珠霉属;曲霉属;从赤壳属;无柄盘菌属。

19. 根据权利要求 18 的方法,其特征在于:

所述炭疽菌属真菌选自香蕉炭疽菌、胶孢炭疽菌、球炭疽菌;

所述镰刀菌属真菌选自半裸镰刀菌、串珠镰刀菌、腐皮镰刀菌、尖孢镰刀菌;

所述轮枝菌属真菌选自可可轮枝孢菌;

所述葡萄孢属真菌选自灰葡萄孢;

所述地丝菌属真菌选自白地霉;

所述拟茎点霉属真菌选自纳塔尔拟茎点霉;

所述色二孢属真菌选自柑桔色二孢;

所述链格孢属真菌选自柑橘链格孢、互隔交链孢菌;

所述疫霉属真菌选自柑橘褐腐疫霉、草莓疫霉、恶疫霉、烟草疫霉;

所述壳针孢属真菌选自 *Septoria depressa*;

所述毛霉属真菌选自梨形毛霉;

所述链核盘菌属真菌选自果生链核盘菌、核果链核盘菌;

所述黑星菌属真菌选自苹果黑星病菌、梨黑星病菌;

所述根霉属真菌选自匍枝根霉、米根霉;

所述小从壳菌属真菌选自围小从壳菌；

所述核盘菌属真菌选自果生核盘菌；

所述长喙菌属真菌选自奇异长喙壳；

所述青霉属真菌选自绳状青霉、扩展青霉、指状青霉、意大利青霉；

所述盘长孢属真菌选自白盘长孢、*Gloeosporium perennans*、果生盘长孢、*Gloeosporium singulata*；

所述壳蛇孢属真菌选自 *Phlyctaena vagabunda*；

所述柱孢属真菌选自苹果柱孢；

所述匍柄霉属真菌选自黄花菜匍柄霉；

所述星裂壳孢属真菌选自 *Phacydiopycnis malirum*；

所述根串珠霉属真菌选自奇异根串株霉；

所述曲霉属真菌选自黑曲霉，炭黑曲霉；

所述丛赤壳属真菌选自干癌丛赤壳。

20. 根据权利要求 15 的方法，其特征在于所述水果和蔬菜选自：谷类；甜菜；梨果和核果和浆果；豆科植物；油脂植物；葫芦科；纤维植物；柑橘类水果；热带水果；蔬菜；十字花科；月桂类植物；或者橡胶植物以及观赏植物、灌木、落叶树和常绿树。

21. 根据权利要求 15 的方法，其特征在于所述水果和蔬菜选自：玉米、烟草、坚果、咖啡、甘蔗、茶叶、葡萄藤、蛇麻草。

22. 根据权利要求 20 的方法，其特征在于：

所述谷类选自小麦、大麦、黑麦、燕麦、水稻、高粱；

所述甜菜选自糖用甜菜和饲料甜菜；

所述梨果和核果和浆果选自苹果、梨、李子、桃、杏、樱桃、草莓、树莓和黑莓；

所述豆科植物选自菜豆、小扁豆、豌豆、黄豆；

所述油脂植物选自油菜、芥菜、罂粟、橄榄、向日葵、椰子、蓖麻、可可、花生；

所述葫芦科选自南瓜、小黄瓜、甜瓜、黄瓜、笋瓜；

所述纤维植物选自棉花、亚麻、大麻、黄麻；

所述柑橘类水果选自橙子、柠檬、葡萄柚、柑橘；

所述热带水果选自番木瓜、西番莲、芒果、杨桃、菠萝、香蕉；

所述蔬菜选自菠菜，莴苣，芦笋；

所述十字花科选自卷心菜和芜菁，胡萝卜，洋葱，番茄，马铃薯，辣椒和甜椒；

所述月桂类植物选自鳄梨、肉桂、樟脑树；

所述观赏植物选自切花、玫瑰、非洲菊和花球茎；

所述常绿树选自松柏类。

23. 根据权利要求 15 的方法，其特征在于所述水果、切花或蔬菜在采收前使用至少一种根据权利要求 15、16 或 17 的式 (I) 的二硫杂环己二烯四甲酰亚胺处理 1 周至 4 周。

24. 根据权利要求 23 的方法，其特征在于所述水果、切花或蔬菜在采收前使用至少一种根据权利要求 15、16 或 17 的式 (I) 的二硫杂环己二烯四甲酰亚胺处理 2 周至 3 周。

25. 根据权利要求 15-24 中任一项的方法，其特征在于将所述水果、切花或蔬菜保护至少 21 天的时间段。

26. 根据权利要求 25 的方法,其特征在於将所述水果、切花或蔬菜保护 21 至 360 天的时间段。

27. 根据权利要求 25 的方法,其特征在於将所述水果、切花或蔬菜保护 45 至 250 天的时间段。

## 二硫杂环己二烯四甲酰亚胺用于保护采收的产品抵抗植物病原性真菌的用途

[0001] 本发明涉及用于保护采收的水果、切花或蔬菜抵抗由于某些存储病害或者在存储条件下表现出的病害所导致的腐烂的方法,所述水果、切花或蔬菜已经在采收前用式 (I) 的二硫杂环己二烯四甲酰亚胺进行过处理。尤其是,本发明涉及式 (I) 的二硫杂环己二烯四甲酰亚胺在采收之前用于保护采收的水果、切花或蔬菜抵抗植物病原性真菌的应用。

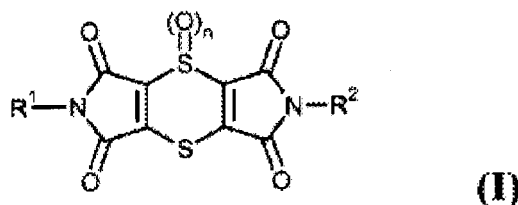
[0002] 任何在采收之前用于水果、切花和蔬菜的植物保护程序的目的是防止病害的发展,所述病害可能损害水果、切花和蔬菜的最终品质,并且也都是为了获得适当的产率。在包装期间用于在水果、切花和蔬菜上进行采收后植物保护产品应用的系统的目的在于在存储和运输到最终消费者期间保护水果和蔬菜的健康。此外,由于对使用现代杀真菌剂的环境和经济性要求不断地增加,例如,在活性谱、毒性、选择性、施用率、残余物形成以及良好的可制备性的等方面,另外,由于可能存在例如已知的活性化合物的抗性发展方面的问题,开发新的杀真菌剂是持久性任务,其至少在一些领域具有超过它们已知的类似物(counterpart) 的优势。因此,仍然需要发现和 / 或开发用于存储病害控制的其他杀真菌剂。二硫杂环己二烯四甲酰亚胺本身是已知的。这些化合物可以用作驱虫剂和杀虫剂(参见 US3, 364, 229) 也是已知的。另外,这些二硫杂环己二烯四甲酰亚胺的杀真菌用途也是已知的(WO2010/043319)。

[0003] 现在令人惊奇地发现,如果在采收之前(采收前)施用二硫杂环己二烯四甲酰亚胺,则所述二硫杂环己二烯四甲酰亚胺可以用于保护水果、切花和蔬菜抵抗存储病害。此外,本发明还涉及通过在采收之前使用二硫杂环己二烯四甲酰亚胺处理被这些病害侵染的作物来对抗某些存储病害的方法。

[0004] 好处是随着将二硫杂环己二烯四甲酰亚胺用于采收前处理,在采收后实现了存储病害的长期控制,从而允许长距离运输采收的水果、切花或蔬菜。

[0005] 因此,本发明涉及至少一种式 (I) 的二硫杂环己二烯四甲酰亚胺或其农业化学品可接受的盐用于保护水果、切花或蔬菜抵抗植物病原性真菌的用途,

[0006]



[0007] 其中

[0008]  $R^1$ 和 $R^2$ 相同或不同并且代表氢, $C_1-C_8$ -烷基,其任选被卤素、 $-OR^3$ ,  $-COR^4$ 单取代或多取代,或者代表 $C_3-C_7$ -环烷基,其任选被卤素、 $C_1-C_4$ -烷基或 $C_1-C_4$ -卤代烷基单取代或多取代,或者代表芳基或芳基- $(C_1-C_4$ -烷基),其各自任选被卤素、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -卤代烷基、 $-COR^4$ 或磺酰基氨基单取代或多取代,

[0009]  $R^3$ 代表氢, $C_1-C_4$ -烷基  $C_1-C_4$ -烷基羰基,或者代表芳基,其任选被卤素、 $C_1-C_4$ -烷基

或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>- 卤代烷基单取代或多取代,

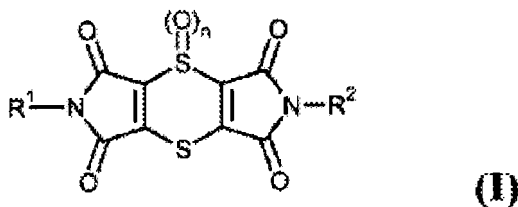
[0010] R<sup>4</sup>代表羟基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>- 烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>- 烷氧基,

[0011] n 代表 0 或 1,

[0012] 其特征在于所述式 (I) 的二硫杂环己二烯四甲酰亚胺在采收前施用。

[0013] 本发明还涉及通过使用至少一种式 (I) 的二硫杂环己二烯四甲酰亚胺在采收前处理水果、切花或蔬菜来抵抗存储病害的方法,

[0014]



[0015] 其中 R<sup>1</sup>和 R<sup>2</sup>如上所定义。

[0016] 式 (I) 提供了可以根据本发明使用的二硫杂环己二烯四甲酰亚胺的一般定义。可以优选使用基团具有如下含义的式 (I) 的甲酰亚胺。

[0017] R<sup>1</sup>和 R<sup>2</sup>优选相同或不同并且优选代表氢,或代表 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷基,其任选被氟、氯、溴、-OR<sup>3</sup>、-COR<sup>4</sup>单取代或多取代,或代表 C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>- 环烷基,其任选被氯、甲基或三氟甲基单取代或多取代,或代表苯基或苄基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>- 烷基),其各自任选被氟、氯、溴、甲基、三氟甲基、-COR<sup>4</sup>、磺酰基氨基单取代或多取代。

[0018] R<sup>1</sup>和 R<sup>2</sup>尤其优选相同或不同并且尤其优选代表氢,或代表 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>- 烷基,其任选被氟、氯、羟基、甲氧基、乙氧基、甲基羰基氧基、羧基单取代或多取代,或代表 C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>- 环烷基,其任选被氯、甲基或三氟甲基单取代或多取代,或代表苯基、苄基、1- 苄乙基、2- 苄乙基或 2- 甲基-2- 苄乙基,其各自任选被氟、氯、溴、甲基、三氟甲基、-COR<sup>4</sup>、磺酰基氨基单取代至三取代。

[0019] R<sup>1</sup>和 R<sup>2</sup>非常尤其优选相同或不同并且非常尤其优选代表氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、2,2- 二氟乙基、2,2,2- 三氟乙基,或代表环丙基或环己基,其各自任选被氯、甲基或三氟甲基取代。

[0020] R<sup>1</sup>和 R<sup>2</sup>特别优选同时代表甲基。

[0021] R<sup>3</sup>优选代表氢、甲基、乙基、甲基羰基、乙基羰基或代表苯基,其任选被氟、氯、甲基、乙基、正丙基、异丙基或三氟甲基单取代或多取代。

[0022] R<sup>3</sup>尤其优选代表氢、甲基、甲基羰基或苯基。

[0023] R<sup>4</sup>优选代表羟基、甲基、乙基、甲氧基或乙氧基。

[0024] R<sup>4</sup>尤其优选代表羟基或甲氧基。

[0025] n优选代表 0。

[0026] n 还优选代表 1。

[0027] n尤其优选代表 0。

[0028] 可以单独提到如下化合物:

[0029] (I-1) 2,6- 二甲基-1H,5H-[1,4] 二硫杂环己二烯并 [2,3-c :5,6-c'] 二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)- 四酮 (即 R<sup>1</sup>=R<sup>2</sup>=甲基, n=0)

[0030] (I-2) 2,6- 二乙基-1H,5H-[1,4] 二硫杂环己二烯并 [2,3-c :5,6-c'] 二吡咯-1,



3,5,7(2H,6H)-四酮(即  $R^1 = R^2 = \text{乙基}$ ,  $n = 0$ )

[0031] (I-3) 2,6-二丙基-1H,5H-[1,4]二硫杂环己二烯并[2,3-c:5,6-c']二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮(即  $R^1 = R^2 = \text{丙基}$ ,  $n = 0$ )

[0032] (I-4) 2,6-二异丙基-1H,5H-[1,4]二硫杂环己二烯并[2,3-c:5,6-c']二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮(即  $R^1 = R^2 = \text{异丙基}$ ,  $n = 0$ )

[0033] (I-5) 2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二硫杂环己二烯并[2,3-c:5,6-c']二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮 4-氧化物(即  $R^1 = R^2 = \text{甲基}$ ,  $n = 1$ )

[0034] 可以特别优选使用化合物(I-1)、(I-2)和(I-3),尤其是化合物(I-1)。

[0035] 根据本发明,在采收前,使用式(I)的二硫杂环己二烯四甲酰亚胺处理的水果、切花或蔬菜1周至4周,优选2周至3周。

[0036] 根据本发明,保护水果、切花或蔬菜至少21天,优选21至360天的时间段,更优选45至250天的时间段。

[0037] 根据本发明,存储病害可以由例如如下真菌所引起:

[0038] 炭疽菌属(*Colletotrichum* spp.),例如香蕉炭疽菌(*Colletotrichum musae*)、胶孢炭疽菌(*Colletotrichum gloeosporioides*)、球炭疽菌(*Colletotrichum coccodes*);镰刀菌属(*Fusarium* spp.),例如半裸镰刀菌(*Fusarium semitectum*)、串珠镰刀菌(*Fusarium moniliforme*)、腐皮镰刀菌(*Fusarium solani*)、尖孢镰刀菌(*Fusarium oxysporum*);轮枝菌属(*Verticillium* spp.),例如可可轮枝孢菌(*Verticillium theobromae*);黑孢霉属(*Nigrospora* spp.);葡萄孢属(*Botrytis* spp.),例如灰葡萄孢(*Botrytis cinerea*);地丝菌属(*Geotrichum* spp.),例如白地霉(*Geotrichum candidum*);拟茎点霉属(*Phomopsis* spp.),纳塔尔拟茎点霉(*Phomopsis natalensis*);色二孢属(*Diplodia* spp.),例如柑桔色二孢(*Diplodia citri*);链格孢属(*Alternaria* spp.),例如柑橘链格孢(*Alternaria citri*)、互隔交链孢菌(*Alternaria alternata*);疫霉属(*Phytophthora* spp.),例如柑橘褐腐疫霉(*Phytophthora citrophthora*)、草莓疫霉(*Phytophthora fragariae*)、恶疫霉(*Phytophthora cactorum*)、烟草疫霉(*Phytophthora parasitica*);壳针孢属(*Septoria* spp.),例如 *Septoria depressa*;毛霉属(*Mucor* spp.),例如梨形毛霉(*Mucor piriformis*);链核盘菌属(*Monilinia* spp.),例如果生链核盘菌(*Monilinia fructigena*)、核果链核盘菌(*Monilinia laxa*);黑星菌属(*Venturia* spp.),例如苹果黑星病菌(*Venturia inaequalis*)、梨黑星病菌(*Venturia pyrina*);根霉属(*Rhizopus* spp.),例如:匍枝根霉(*Rhizopus stolonifer*)、米根霉(*Rhizopus oryzae*);小丛壳菌属(*Glomerella* spp.),例如围小丛壳菌(*Glomerella cingulata*);核盘菌属(*Sclerotinia* spp.),例如果生核盘菌(*Sclerotinia fruiticola*);长喙菌属(*Ceratocystis* spp.),例如奇异长喙壳(*Ceratocystis paradoxa*);青霉属(*Penicillium* spp.),例如绳状青霉(*Penicillium funiculosum*)、扩展青霉(*Penicillium expansum*)、指状青霉(*Penicillium digitatum*)、意大利青霉(*Penicillium italicum*);盘长孢属(*Gloeosporium* spp.),例如白盘长孢(*Gloeosporium album*)、*Gloeosporium perennans*、果生盘长孢(*Gloeosporium fructigenum*)、*Gloeosporium singulata*;壳蛇孢属(*Phlyctaena* spp.),例如 *phlyctaena vagabunda*;柱孢属(*Cylindrocarpon* spp.),例如苹果柱孢(*Cylindrocarpon mali*);匍柄霉属(*Stemphyllium* spp.),例如黄花菜匍柄霉(*Stemphyllium vesicarium*);星裂壳孢

属 (*Phacydiopycnis* spp.), 例如 *Phacydiopycnis malirum*; 根串珠霉属 (*Thielaviopsis* spp.), 例如奇异根串珠霉 (*Thielaviopsis paradoxy*); 曲霉属 (*Aspergillus* spp.), 例如黑曲霉 (*Aspergillus niger*), 炭黑曲霉 (*Aspergillus carbonarius*); 从赤壳属 (*Nectria* spp.), 例如干癌丛赤壳 (*Nectria galligena*); 无柄盘菌属 (*Pezicula* spp.)。

[0039] 根据本发明, 存储病害例如是灼伤、烧焦、软化、衰败、皮孔斑点、苦陷、褐化、苹果水心病、维管损伤、CO<sub>2</sub> 损害、CO<sub>2</sub> 缺乏和 O<sub>2</sub> 缺乏。

[0040] 根据本发明待处理的水果、切花和蔬菜特别选自谷类, 例如小麦、大麦、黑麦、燕麦、水稻、高粱等; 甜菜, 例如糖用甜菜和饲料甜菜; 梨果和核果和浆果, 例如苹果、梨、李子、桃、杏、樱桃、草莓、树莓和黑莓; 豆科植物, 例如菜豆 (beans)、小扁豆、豌豆、黄豆; 油脂植物, 例如油菜、芥菜、罂粟、橄榄、向日葵、椰子、蓖麻、可可、花生; 葫芦科, 例如南瓜 (pumpkins)、小黄瓜、甜瓜、黄瓜、笋瓜 (squashes); 纤维植物, 例如棉花、亚麻、大麻、黄麻; 柑橘类水果, 例如橙子、柠檬、葡萄柚、柑橘; 热带水果, 例如番木瓜、西番莲、芒果、杨桃、菠萝、香蕉; 蔬菜, 例如菠菜, 莴苣, 芦笋; 十字花科, 例如卷心菜和芜菁, 胡萝卜, 洋葱, 番茄, 马铃薯, 辣椒和甜椒; 月桂类植物, 例如鳄梨、肉桂、樟脑树; 或者如下植物, 例如玉米、烟草、坚果、咖啡、甘蔗、茶叶、葡萄藤、蛇麻草, 橡胶植物以及观赏植物, 例如切花、玫瑰、非洲菊和花球茎 (flower bulbs)、灌木、落叶树和常绿树例如松柏类。栽培植物的这种列举是为了示例本发明的目的给出而不是对它进行限定。

[0041] 特别优选的是梨果和核果和浆果的处理, 尤其是苹果、梨、李子、桃、杏、樱桃、草莓、树莓和黑莓。

[0042] 特别优选的是柑橘类水果的处理, 尤其是橙子、柠檬、葡萄柚、柑橘。特别优选的是热带水果的处理, 尤其是番木瓜、西番莲、芒果、杨桃、菠萝、香蕉。

[0043] 特别优选的是葡萄藤的处理。

[0044] 根据本发明使用的杀真菌剂通常以组合物的形式施用, 所述组合物包含至少一种上述二硫杂环己二烯四甲酰亚胺杀真菌剂。优选地, 所述杀真菌剂组合物包含农业上可接受的添加剂、溶剂、载体、表面活性剂或增量剂。

[0045] 根据本发明, 载体被理解是指天然的或合成的有机或无机物质, 其与所述活性物质混合或组合以更好地适用, 特别是施用于植物或植物部分或种子。可为固态或者液态的所述载体一般是惰性的且应该适用于农业。

[0046] 合适的固体或液体载体为: 例如铵盐和天然的磨碎矿石, 如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、凹凸棒石、蒙脱石或硅藻土, 以及合成的磨碎矿石, 如细碎的二氧化硅、氧化铝及天然或合成的硅酸盐、树脂、蜡、固体肥料、水、醇尤其是丁醇、有机溶剂、矿物油和植物油以及它们的衍生物。还可使用这些载体的混合物。适宜的用于粒剂的固体载体为: 例如粉碎并分级的天然矿石, 例如方解石、大理石、浮石、海泡石、白云石, 以及合成的无机和有机粉的颗粒, 以及有机材料的颗粒, 如锯末、椰壳、玉米棒子及烟草杆。

[0047] 合适的液化的气态增量剂或载体是这样的液体, 其在常温和常压下是气体, 例如气溶胶喷射剂, 如丁烷、丙烷、氮气和二氧化碳。

[0048] 在制剂中可使用胶粘剂如羧甲基纤维素, 粉末、颗粒或胶乳形式的天然及合成的聚合物, 如阿拉伯树胶、聚乙烯醇、聚乙酸乙烯酯, 或者其它天然磷脂, 如脑磷脂和卵磷脂以及合成磷脂。其它可行的添加剂为矿物油和植物油和蜡, 任选为改性的。

[0049] 如果使用的增量剂为水,也可用例如使用有机溶剂作为助溶剂。合适的液体溶剂主要为:芳族化合物,如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯化的芳族化合物或氯化的脂族烃,如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,如环己烷或石蜡,例如矿物油馏分、矿物油和植物油;醇类,如丁醇或乙二醇以及它们的醚和酯,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基亚砷,以及水。

[0050] 根据本发明的组合物还可进一步包含另外的组分,例如表面活性剂。合适的表面活性剂为具有离子或非离子特性的乳化剂、分散剂或润湿剂、或这些表面活性剂的混合物。这些物质的实例为聚丙烯酸的盐、木素磺酸的盐、苯酚磺酸或萘磺酸的盐、环氧乙烷与脂肪醇或与脂肪酸或与脂肪胺的缩聚物、取代的酚类(优选烷基酚或芳基酚)、磺基琥珀酸酯的盐、牛磺酸衍生物(优选牛磺酸烷基酯)、聚乙氧基化的醇或酚的磷酸酯、多元醇的脂肪酸酯,以及含有硫酸酯、磺酸酯和磷酸酯的化合物的衍生物。如果一种活性化合物和/或一种惰性载体是不溶于水的,并且该应用是在水中进行的,则要求存在表面活性剂。表面活性剂的比例是根据本发明的组合物的5-40重量%。

[0051] 可以使用着色剂,如无机颜料,例如氧化铁、氧化钛、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,以及痕量营养物质,如铁、锰、硼、铜、钴、钼以及锌的盐。

[0052] 如何合适的话,也可存在其它附加组分,例如保护性胶体、粘结剂、粘合剂、增稠剂、触变物质、渗透剂、稳定剂、多价螯合剂、络合形成剂(complex former)。一般说来,所述活性化合物可以与通常用于制剂目的的任何固体或液体添加剂组合。

[0053] 一般而言,根据本发明的组合物含有0.05-99重量%、0.01-98重量%、优选为0.1-95重量%、特别优选0.5-90重量%、非常特别优选10-70重量%的根据本发明的活性化合物组合产品。

[0054] 根据本发明的活性化合物组合产品或组合物可以以原样使用、或取决于它们各自的物理和/或化学性质以它们的制剂形式或由此制成的使用形式来使用,如气溶胶、胶囊悬浮剂、冷雾化浓缩剂、热雾化浓缩剂、胶囊粒剂、细粒剂、用于种子处理的可流动浓缩剂、即用型溶液、可喷洒粉剂、可乳化浓缩剂、水包油型乳剂、油包水型乳剂、大颗粒剂、微颗粒剂、油可分散粉末、油可混溶可流动浓缩剂、油可混溶液体、泡沫剂、糊剂、杀虫剂涂布的种子、悬浮浓缩剂、悬浮-乳化-浓缩剂、可溶浓缩剂、悬浮剂、可润湿粉剂、可溶性粉剂、粉剂和颗粒剂、水可溶性颗粒剂或片剂、用于种子处理的水可溶性粉剂、可湿性粉剂、用活性化合物浸渍的天然产物以及合成物,以及在聚合物物质中和种子涂布材料中的微胶囊,以及ULV冷雾化-和热雾化制剂。

[0055] 可以以本身已知的方法制备所提及的制剂,例如通过将活性化合物或活性化合物组合产品与至少一种添加剂混合。合适的添加剂为所有常规制剂助剂,例如有机溶剂、增量剂、溶剂或稀释剂、固体载体和填料、表面活性剂(如助剂、乳化剂、分散剂、保护性胶体、润湿剂和胶粘剂)、分散剂和/或粘合剂或固定剂、防腐剂、染料和颜料、消泡剂、无机和有机增稠剂、憎水剂、如果合适的话干燥剂和UV稳定剂、赤霉素和水以及其它加工助剂。取决于在各种情况下制备的制剂类型,可能需要其它加工步骤,例如湿磨、干磨或造粒。

[0056] 根据本发明的组合物不仅包括可用适合的装置施用到植物或种子上的即用型组合物,还包括使用前必须用水稀释的市售浓缩剂。

[0057] 根据本发明的活性化合物组合产品可以作为与其它(已知的)活性化合物的混合

物存在于（市售的）制剂中以及在由这些制剂制备的使用形式中，所述其它（已知的）活性化合物如杀虫剂、引诱剂、消毒剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、生长调节剂、除草剂、肥料、安全剂和化学信息素。

[0058] 根据本发明用活性化合物或组合物对植物及植物部分的处理通过使用常规处理方法直接进行或通过作用于其环境、生境或贮存空间进行，所述常规处理方法为例如通过浸渍、喷射、雾化、灌溉、蒸发、撒粉、雾化、撒播、发泡、涂布、涂铺、浇灌（浸润）、滴灌，以及在繁殖材料，特别是在种子的情况中，此外通过结壳、通过用一层或多层涂覆等作为用于干种子处理的粉末、用于种子处理的溶液、用于浆液处理的水溶性粉末。此外，还可通过超低容量法施用活性化合物或将活性化合物制剂或活性化合物本身注射到土壤中。

[0059] 如上面已经提到的，所有的植物和它们的部分均可根据本发明进行处理。在一个优选的实施方案中，对野生的或者通过常规生物育种方法，如杂交或原生质体融合得到的植物种类和植物栽培品种及其部分进行处理。在另一优选的实施方案中，对通过基因工程方法（如果合适的话与常规方法结合）获得的转基因植物和植物栽培品种（基因修饰生物）及其部分进行处理。术语“部分”、“植物的部分”和“植物部分”已在上文解释。特别优选地，根据本发明对在各种情况下市售可得的或正在使用的植物栽培品种的植物进行处理。植物栽培品种被理解是指通过传统育种、通过诱变或通过重组 DNA 技术已经获得的具有新性质（“特性”）的植物。它们可以是栽培品种、生物型或基因型。

[0060] 根据本发明的处理方法可以用于处理遗传修饰生物（GMOs），例如，植物或种子。遗传修饰植物（或转基因植物）是异源基因已经被稳定整合成基因组的植物。表述“异源基因”基本上是指这样一种基因，其在植物以外提供或装配，并在引入核基因组、叶绿体基因组或线粒体基因组中时可以通过表达目的蛋白或多肽或者通过下调或沉默植物中存在的一种或多种其它基因（使用例如反义技术、共抑制技术或 RNA 干扰 -RNAi- 技术）给予所转化的植物新的或改善的农学或其它特性。位于基因组中的异源基因同样被称为转基因。由其在植物基因组中特定位置定义的转基因称为转化 - 或转基因事件。

[0061] 优选根据本发明处理的植物和植物栽培品种包括所有具有遗传材料的植物，所述遗传材料赋予这些植物特别有利的、有用的特征（无论是通过育种和 / 或生物工程方式获得）。

[0062] 同样优选根据本发明处理的植物和植物栽培品种耐受一种或多种生物胁迫，即所述植物显示出对动物和微生物有害物（如线虫类、昆虫、螨类、植物病原性真菌、细菌、病毒和 / 或类病毒）的更好的抵御。

[0063] 线虫类抵御植物的实例描述于例如美国专利申请号 11/765, 491、11/765, 494、10/926, 819、10/782, 020、12/032, 479、10/783, 417、10/782, 096、11/657, 964、12/192, 904、11/396, 808、12/166, 253、12/166, 239、12/166, 124、12/166, 209、11/762, 886、12/364, 335、11/763, 947、12/252, 453、12/209, 354、12/491, 396 和 12/497, 221 中。

[0064] 同样可根据本发明处理的植物和植物栽培品种是耐受一种或多种非生物胁迫的那些植物。非生物胁迫条件可包括，例如，干旱、低温暴露、热暴露、渗透胁迫、涝、增加的土壤盐含量、增加的矿物暴露、臭氧暴露、强光暴露、氮养分有限的可利用率、磷养分有限的可利用率、避免遮光。

[0065] 同样可根据本发明处理的植物和植物栽培品种是特征在于提高的产率特性的那

些植物。在所述植物中,提高的产量可以归因于,例如,改进的植物生理、生长和发育如水分利用效率、保水效率、改进的氮利用、提高的碳素同化作用、改进的光合作用、提高的发芽率以及加速成熟。此外,产量会受改进的植物结构(在胁迫-及非胁迫条件下)的进一步影响,包括但不限于提早开花、对生产杂交种子的开花控制、秧苗势、植物大小、节间数和距离、根系生长、种子大小、果实大小、荚果大小、荚果数或穗数、每个荚果或穗的种子数、种子质量、提高的种子饱满度、降低的种子传播、降低的荚果开裂和抗倒伏性。其它产量特征包括种子组成,例如碳水化合物含量、蛋白质含量、油含量和组成、营养价值、对营养不利的化合物的减少、改进的可加工性和改进的存储稳定性。

[0066] 可根据本发明处理的植物为已经表现出杂种优势或杂交优势特征的杂交植物,所述杂交植物通常导致更高的产量、更高的活力、更好的健康度和更好的对生物及非生物胁迫的抗性。这样的植物通常由一种自交雄性不育株亲系(母本)与另一种自交雄性能育亲系(父本)杂交得到。杂种种子通常从雄性不育植物上采收并售给栽培者。雄性不育植物有时(例如,在玉米中)可以通过去雄花穗(即机械去除雄性性器官或雄花)制得;但是,更通常地,雄性不育性由植物基因组中的遗传决定子获得。这种情况下,尤其是当希望从杂交植物采收的产品是种子时,确保杂种植物的雄性能育性完全恢复通常是有用的。这可以通过确保父本具有合适的能够恢复杂种植物中雄性能育性的育性恢复基因而实现,所述杂种植物包含造成雄性不育的遗传决定子。雄性不育的遗传决定子可位于细胞质中。细胞质雄性不育(CMS)的实例在例如芸苔属中描述。然而,雄性不育遗传决定子也可以位于核基因组中。雄性不育植物也可以通过植物生物技术法例如遗传工程来得到。W089/10396描述了一种得到雄性不育植物的特别有用的方法,其中例如核糖核酸酶如芽孢杆菌RNA酶在雄蕊中的绒毡层细胞中选择性地表达。然后能育性可以通过绒毡层细胞中核糖核酸酶抑制剂例如芽孢杆菌RNA酶抑制剂的表达来恢复。

[0067] 可根据本发明处理的植物或植物栽培品种(通过植物生物技术方法例如遗传工程得到)为除草剂抗性植物,即耐受一种或多种给定的除草剂的植物。这样的植物可以通过遗传转化,或通过选择包含赋予这样的除草剂抗性的突变的植物来得到。

[0068] 除草剂抗性植物例如为耐受草甘膦的植物,即耐受除草剂草甘膦或其盐的植物。植物可以通过不同的方式耐受草甘膦。例如,草甘膦耐受性植物可以通过用编码酶5-烯醇丙酮酰基莽草酸-3-磷酸合酶(5-Enolpyruvylshikimate-3-phosphate synthase)(EPSPS)的基因转化植物而获得。这样的EPSPS基因的实例为细菌鼠伤寒沙门菌(*Salmonella typhimurium*)的AroA基因(突变体CT7)(Comai等,1983, *Science*221, 370-371)、细菌农杆菌(*Agrobacterium sp.*)的CP4基因(Barry等,1992, *Curr. Topics Plant Physiol.* 7, 139-145)、编码矮牵牛的EPSPS(Shah等,1986, *Science*233, 478-481)、番茄的EPSPS(Gasser等,1988, *J. Biol. Chem.* 263, 4280-4289)或牛筋草(*Eleusine*)的EPSPS(W001/66704)的基因。也可以是突变的EPSPS。草甘膦耐受性植物也可以通过表达编码草甘膦氧化还原酶-酶的基因来得到。草甘膦耐受性植物也可以通过表达编码草甘膦乙酰基转移酶-酶的基因来得到。草甘膦耐受性植物也可以通过选择包含上述基因的天然发生突变的植物来得到。描述了表达赋予草甘膦耐受性的EPSPS基因的植物。描述了包含其他赋予草甘膦耐受性的基因如脱羧酶基因的植物。

[0069] 其它除草剂耐受性植物是例如那些耐受抑制酶谷氨酰胺合成酶的除草剂如双丙

氨膦、草胺膦 (Phosphinotricin) 或草铵膦 (草胺膦) 的植物。这样的植物可以通过表达如下的酶来得到,所述酶解除除草剂或者耐受抑制作用的谷氨酰胺合成酶的酶突变体的毒性。一种这样有效的解毒酶是编码草胺膦乙酰转移酶的酶(例如链霉菌属各种的 bar- 或 pat- 蛋白)。表达外源草胺膦乙酰转移酶的植物也有所描述。

[0070] 其它除草剂耐受性植物也可为耐受抑制酶羟基苯丙酮酸双加氧酶 (HPPD) 的除草剂的植物。HPPD 是催化对羟基苯丙酮酸 (HPP) 转变为尿黑酸的反应的酶。如 W096/38567、W099/24585、W099/24586、W02009/144079、W02002/046387 或 US6,768,044 中所记载的,耐受 HPPD 抑制剂的植物可以用编码天然存在的耐受 HPPD 的酶的基因进行转化,或者用编码突变的或嵌合的 HPPD 酶的基因进行转化。通过用编码某些能形成尿黑酸的酶的基因转化植物,也可以得到对 HPPD 抑制剂的耐受性,尽管 HPPD 抑制剂抑制天然的 HPPD 酶。这样的植物和基因记载于 W099/34008 和 W002/36787 中。如 W02004/024928 中所记载的,除了使用编码 HPPD 耐受酶的基因以外,通过用编码具有预苯酸脱氢酶 (PDH) 活性的酶的基因转化植物,也可以提高植物对 HPPD 抑制剂的耐受性。此外,植物可以通过加入到它们的基因组中来进一步耐受 HPPD 抑制剂除草剂,所述基因组即编码能够使 HPPD 抑制剂代谢或降解的酶(如 W02007/103567 中 W02008/150473 中所示的酶 CYP450) 的基因。

[0071] 其它除草剂耐受性植物是耐受乙酰乳酸合酶 (ALS) 抑制剂的植物。已知的 ALS 抑制剂包括,例如磺酰脲、咪唑啉酮、三唑并嘧啶类、嘧啶基氧基(硫代)苯甲酸酯类和/或磺酰基氨基羰基三唑啉酮除草剂。如例如在 Tranel 和 Wright(2002, Weed Science 50: 700-712) 中所记载的,已知酶 ALS 酶(同样被称为乙酰羟酸合酶, AHAS) 中不同突变赋予对不同除草剂和除草剂组的耐受性。记载了磺酰脲耐受性植物和咪唑啉酮耐受性植物的产生。也记载了其他咪唑啉酮耐受性植物。此外还记载了磺酰脲-和咪唑啉酮-耐受性植物。

[0072] 通过诱导的诱变、在除草剂存在下的细胞培养物中的选择或者通过诱变育种,可以得到其它耐受咪唑啉酮和/或磺酰脲的植物,如美国专利 5,084,082 中所记载的大豆、W097/41218 中所记载的水稻、美国专利 5,773,702 和 W099/057965 中所记载的甜菜、美国专利 5,198,599 中所记载的生菜、或 W001/065922 中所记载的向日葵。

[0073] 同样可根据本发明处理的植物或植物栽培品种(通过植物生物技术方法如遗传工程得至)是具有昆虫抗性的转基因植物,即对某些目标昆虫的侵害具有抗性的植物。这样的植物可以通过遗传转化得到,或者通过选择包含赋予所述昆虫抗性的突变的植物而得到。

[0074] 如本文中所使用的“昆虫抗性的转基因植物”包括包含至少一个转基因的任意植物,所述转基因包括编码下列蛋白的编码序列:

[0075] 1) 苏云金芽孢杆菌 (*Bacillus thuringiensis*) 的杀虫晶体蛋白或其杀虫部分,诸如由 Crickmore 等(1998, Microbiology and Molecular Biology Reviews, 62: 807-813)、由 Crickmore 等在苏云金芽孢杆菌毒素命名法中升级(2005),在线在 [http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil\\_Crickmore/Bt/](http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/) 处)列出的杀虫晶体蛋白或其杀虫部分;例如 Cry 蛋白类别 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1B、Cry1C、Cry1D、Cry1F、Cry2Ab、Cry3Aa 或 Cry3Bb 的蛋白或其杀虫部分(例如 EP1999141 和 W02007/107302);或者通过合成基因(例如美国专利申请 No12/249,016 中所记载的)编码的这样的蛋白;或者

[0076] 2) 苏云金芽孢杆菌的晶体蛋白或其部分,所述蛋白或部分在第二种除苏云金芽孢

杆菌以外的晶体蛋白或其部分存在下起杀虫作用,如由 Cry34 和 Cry35 晶体蛋白组成的二元毒素 (Moellenbeck 等 .2001, Nat.Biotechnol. 19 :668-72 ;Schnepf 等 .2006, Applied Environm. Microbiol. 71,1765-1774) 或由 Cry1A 和 Cry1F 蛋白和 Cry2Aa 或 Cry2Ab 或 Cry2Ae 蛋白组成的二元毒素 (美国专利申请 No. 12/214, 022 和 EP08010791.5) ;或者

[0077] 3) 包括苏云金芽孢杆菌的不同的杀虫晶体蛋白的部分的杀虫蛋白杂合体,例如上述 1) 蛋白的杂合体或上述 2) 蛋白的杂合体,例如,由玉米事件 MON89034 生产的蛋白质 Cry1A.105(WO2007/027777) ;或者

[0078] 4) 上述点 1) 至 3) 的任意一种蛋白质,其中有些,特别是 1-10 个氨基酸已经被另一种氨基酸替代以得到更高的对目标昆虫物种的更高的杀虫活性,和 / 或来扩大受影响的目标昆虫物种的范围,和 / 或由于在克隆或转化过程中引入至编码 DNA 中的变化,如棉花事件 MON863 或 MON88017 中的 Cry3Bb1 蛋白、或棉花事件 MIR604 中的 Cry3A 蛋白 ;或者

[0079] 5) 来自苏云金芽孢杆菌或蜡样芽孢杆菌的杀虫剂分泌性蛋白或其杀虫剂部分,如列于 [http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil\\_Crickmore/Bt/vip.html](http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html) 中的营养性杀虫剂 (VIP) 蛋白,例如来自 VIP3Aa 蛋白类别的蛋白 ;或者

[0080] 6) 来自苏云金芽孢杆菌或蜡样芽孢杆菌的分泌性蛋白,其在来自苏云金芽孢杆菌或蜡样芽孢杆菌的第二分泌性蛋白的存在下起杀虫作用,如由 VIP1A 和 VIP2A 蛋白组成的二元毒素 (WO94/21795) ;或者

[0081] 7) 包含来自不同的分泌性蛋白的部分的杀虫蛋白杂合体,所述不同的分泌性蛋白来自苏云金芽孢杆菌或蜡样芽孢杆菌,如上述 1) 中的蛋白杂合体或上述 2) 中的蛋白杂合体 ;或者

[0082] 8) 上述点 5) 至 7) 的任意一种蛋白质,其中有些,特别是 1-10 个氨基酸已经被另一种氨基酸替代以得到对目标昆虫物种的更高的杀虫活性,和 / 或来扩大受影响的目标昆虫物种的范围,和 / 或由于在克隆或转化过程中引入至编码 DNA 中的变化 (同时仍然编码杀虫蛋白质),如棉花事件 COT102 中的蛋白 VIP3Aa ;或者

[0083] 9) 来自苏云金芽孢杆菌或蜡样芽孢杆菌的分泌性蛋白,其在来自苏云金芽孢杆菌的晶体蛋白的存在下起杀虫作用,如由 VIP3 和 Cry1A 或 Cry1F (美国专利申请 No. 61/126083 和 61/195019) 组成的二元毒素或由 VIP3 蛋白和 Cry2Aa 或 Cry2Ab 或 Cry2Ae 蛋白 (美国专利申请 No. 12/214, 022 和 EP08010791.5) 组成的二元毒素。

[0084] 10) 上述点 9) 的蛋白质,其中有些,特别是 1-10 个氨基酸已经被另一种氨基酸替代以得到对目标昆虫物种的更高的杀虫活性,和 / 或来扩大受影响的目标昆虫物种的范围,和 / 或由于在克隆或转化过程中引入至编码 DNA 中的变化 (同时仍然编码杀虫蛋白质)。

[0085] 当然,如本文中所使用的,昆虫抗性转基因植物也包括含有编码上述 1-10 类中的任意一种蛋白质的基因组合的任何植物。在一个实施方式中,昆虫抗性植物包括多于一种编码上述 1-10 类的任一项的蛋白质的转基因,通过使用具有对同样的目标昆虫种类起杀虫作用但是具有不同的作用模式 (如结合于昆虫中不同的受体结合位点) 的不同蛋白质,以当使用在不同的目标昆虫物种处定向的不同的蛋白时扩大受影响的目标昆虫物种的范围或延迟昆虫对植物形成抗性。

[0086] 如本文中所使用的,“昆虫抗性转基因植物”还包括含有至少一种转基因的任何植

物,所述转基因包含表达双链 RNA 之后产生的序列,其在被植物昆虫害虫摄取后抑制昆虫害虫的生长。

[0087] 同样可根据本发明处理的植物或植物栽培品种(通过植物生物技术方法如遗传工程得到)可耐受非生物胁迫。这样的植物可以通过遗传转化,或者通过选择含有赋予这样的胁迫耐受性的突变的植物而得到。特别有用的胁迫耐受性植物包括:

[0088] 1) 含有能降低植物细胞或植物中聚(ADP-核糖)聚合酶(PARP)的基因表达和/或活性的转基因的植物。

[0089] 2) 含有能降低植物或植物细胞中 PARG 编码基因的表达和/或活性的促进胁迫耐受性的转基因的植物。

[0090] 3) 含有促进胁迫耐受性的转基因的植物,所述转基因编码植物中烟酰胺腺嘌呤二核苷酸补救生物合成途径的功能酶,包括烟酰胺酶、烟酸磷酸核糖基转移酶、烟酸单核苷酸腺嘌呤转移酶、烟酰胺腺嘌呤二核苷酸合成酶或烟酰胺磷酸核糖基转移酶。

[0091] 同样可根据本发明处理的植物或植物栽培品种(通过植物生物技术方法如遗传工程得到)表现出改变的采收产物的量、品质和/或贮存稳定性和/或采收产物的特定成分改变的性质,例如:

[0092] 1) 合成改性淀粉的转基因植物,所述改性淀粉的物理化学性质,特别是直链淀粉的含量或直链淀粉/支链淀粉的比例、支化度、平均链长、侧链的分布、粘性、胶凝强度、淀粉颗粒粒径和/或淀粉颗粒的形态与在野生型植物细胞或植物中合成的淀粉相比有所改变,因此改性淀粉更好地适合特定用途。

[0093] 2) 合成非淀粉碳水化合物聚合物或合成与未遗传改性的野生型植物相比性质改变的非淀粉碳水化合物聚合物的转基因植物。实例是产生多聚果糖尤其是菊糖和果聚糖类型的植物,产生  $\alpha$ -1,4-葡聚糖的植物,产生  $\alpha$ -1,6-分枝的  $\alpha$ -1,4-葡聚糖的植物,和产生交替糖(Alternan)的植物,

[0094] 3) 产生透明质酸的转基因植物,

[0095] 4) 转基因植物或杂种植物,如具有特征如‘高溶解性固体含量’、‘低刺激性’(LP)和/或‘长期贮存性’(LS)的洋葱。

[0096] 同样可根据本发明处理的植物或植物栽培品种(可以通过植物生物技术方法例如遗传工程得到)是具有改变的纤维性质的植物,如棉花植物。这些植物可通过遗传转化,或通过选择含有赋予这种改变的纤维特性的突变的植物而得到,包括以下植物:

[0097] a) 植物如棉花植物,其含有纤维素合成酶基因的变型;

[0098] b) 植物如棉花植物,其含有 rsw2- 或 rsw3- 同源核酸的变型植物如棉花植物,其具有增加的蔗糖磷酸合酶表达;

[0099] c) 植物如棉花植物,其具有增加的蔗糖合酶表达;

[0100] d) 植物如棉花植物,其中纤维细胞基底处胞间连丝开启的时间安排例如通过纤维选择性的  $\beta$ -1,3-葡聚糖酶的下调而被改变;

[0101] e) 植物如棉花植物,其具有通过表达包括 nodC 的 N-乙酰基葡萄糖胺转移酶基因和甲质素合成酶基因而具有改变的反应性的纤维。

[0102] 同样可根据本发明处理的植物或植物栽培品种(可以通过植物生物技术方法例如遗传工程得到)是具有改变的油特性的植物,如油菜和相关芸苔属植物。这类植物可通



过遗传转化或通过选择含有赋予这种改变的油特性的突变的植物而得到,包括以下植物:

[0103] a) 植物如油菜植物,其产生具有高油酸含量的油。

[0104] b) 植物如油菜植物,其产生具有低亚麻酸含量的油。

[0105] c) 植物如油菜植物,其产生具有低饱和脂肪酸含量的油。

[0106] 同样可根据本发明处理的植物或植物栽培品种(可以通过植物生物技术方法例如遗传工程得到)是如下植物,如马铃薯,其具有抗病毒性,例如对抗马铃薯病毒 Y(来自 Tecnoplant、Argentina 的事件 SY230 和 SY233)、其具有病害抗性,例如对抗马铃薯晚疫病(例如, RB 基因)、其显示出减少低温诱导增甜(携带 Nt-Inhh、IIR-INV 基因)或其具有显性矮特性(基因 A-20 氧化酶)。

[0107] 同样可根据本发明处理的植物或植物栽培品种(可以通过植物生物技术方法例如遗传工程得到)是具有改变的落粒性特征的植物,如油菜或相关的芸苔属植物。可以通过基因转化、或通过选择植物获得的这样的植物含有赋予这样改变的落粒性特征的突变体并包括植物如具有延迟或减少落粒性的油菜植物。

[0108] 可以根据本发明处理的特别有用的转基因植物是包含转化事件或转化事件的组合的植物,其是在美国规模种植许可(non-regulated status)下向美国农业部(USDA)的动植物卫生检验署(APHIS)请求是否这样的请求被授权或仍在审理中的主题。在任何时候,这种信息都容易获自 APHIS(4700River Road Riverdale,MD20737,USA),例如在其网站上(URL[http://www.aphis.usda.gov/brs/not\\_reg.html](http://www.aphis.usda.gov/brs/not_reg.html))。在本申请的申请日,在规模种植许可下由 APHIS 审理中的或被 APHIS 授权的请求是含有如下信息的那些:

[0109] - 请求:请求的识别号。转变事件的技术描述可以在各个请求文件中找到,所述请求文件可获自 APHIS,例如在 APHIS 网站上,参考请求号。这些描述通过引用的方式并入本文中。

[0110] - 请求延期:参考要求延期的在先请求。

[0111] - 机构:提交请求的单位名称。

[0112] - 限定物:所涉及的植物种类。

[0113] - 转基因显性:通过转化事件赋予植物的特征。

[0114] - 转化事件或系:一种或多种事件的名称(有时也称为一种或多种系),其要求规模种植许可。

[0115] - APHIS 文件:由 APHIS 公开的各种文件,与请求有关并可以由 APHIS 提出要求。

[0116] 可根据本发明来处理的特别有用的转基因植物是包含编码一种或多种毒素的一种或多种基因的植物,如以下列商品名出售的:YIELD GARD®(例如玉米、棉花、大豆)、KnockOut®(例如玉米)、BiteGard®(例如玉米)、BT-Xtra®(例如玉米)、StarLink®(例如玉米)、Bollgard®(棉花)、Nucotn®(棉花)、Nucotn 33B®(棉花)、NatureGard®(例如玉米)、Protecta®和NewLeaf®(马铃薯)。可提及的除草剂耐受性植物的实例是以下列商品名出售的玉米品种、棉花品种和大豆品种:Roundup Ready®(耐受草甘膦,例如玉米、棉花、大豆)、Liberty Link®(耐受草胺膦,例如油菜)、IMI®(耐受咪唑啉酮)和 STS®(耐受磺酰脲,例如玉米)。可提及的除草剂抗性植物(以除草剂耐受的常规方式育种的植物)包括以在Clearfield®名称(例如玉米)下出售的品种。

[0117] 含有单一转化事件或转化事件组合的另外的特别有用的植物例如列于来自各种国家或地区管理机构的数据库(参见例如 [http://gmoinfo.jrc.it/gmp\\_browse.aspx](http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx) [http://cera-gmc.org/index.php?evidcode=&hstI DXCode=&gType=&AbbrCode=&atCode=&stCode=&coIDCode=&action=gm\\_cro\\_p\\_database&mode=Submit](http://cera-gmc.org/index.php?evidcode=&hstI DXCode=&gType=&AbbrCode=&atCode=&stCode=&coIDCode=&action=gm_cro_p_database&mode=Submit))。

[0118] 在根据本发明的处理方法中通常施用的活性化合物的剂量/施用率通常并且有利地为 0.005 至 70 重量%, 优选为 0.01 至 20 重量%, 更优选为 0.05 至 10 重量%, 取决于为了特定应用目的所选择的制剂类型。

[0119] 本文中所指出的剂量以根据本发明的方法的示例性实例的形式给出。本领域技术人员将知道如何适应施用剂量, 尤其是根据待处理的植物或作物的性质进行。

[0120] 在对抗害虫和/或植物病原性真菌和/或微生物进行处理之后, 可以使用根据本发明的组合产品在在某段时间范围内保护植物。在处理前, 起保护作用的时间范围基本最多 90 天, 优选最多 45 天至 90 天。

[0121] 此外, 根据本发明的组合和组合物还可以用于降低植物和采收的植物材料并因此由其制成的食物和动物饲料中霉菌毒素的含量。具体地但并非穷举地, 以下霉菌毒素可以具体为: 脱氧雪腐镰刀菌烯醇 (Deoxynivalenole, DON)、瓜萎镰菌醇、15-Ac-DON、3-Ac-DON、T2- 和 HT2- 毒素、腐马素毒素 (Fumonisin)、玉米赤霉烯酮 (Zearalenone)、念珠镰刀菌素 (Moniliformin)、镰刀菌素 (Fusarin)、蛇形菌素 (Diaceotoxyscirpenol, DAS)、白僵菌素 (Beauvericin)、恩镰孢菌素 (Enniatin)、层出镰孢菌素 (Fusaroproliferin)、Fusarenol、赭曲霉毒素 (Ochratoxins)、棒曲霉素 (Patulin)、麦角生物碱 (Ergotalkaloids) 和黄曲霉毒素 (Aflatoxins), 这些毒素可由例如以下真菌病害产生: 镰刀霉属各种 (*Fusarium spec.*) 例如锐顶镰刀菌 (*Fusarium acuminatum*)、燕麦镰刀菌 (*F. avenaceum*)、克地镰刀菌 (*F. crookwellense*)、黄色镰孢 (*F. culmorum*)、禾谷镰刀菌 (小麦赤霉病) (*F. graminearum* (*Gibberella zeae*))、水贼镰刀菌 (*F. equiseti*)、*F. fujikoroi*、香蕉镰刀菌 (*F. musarum*)、尖孢镰刀菌 (*F. oxysporum*, )、再育镰刀菌 (*F. proliferatum*)、梨孢镰刀菌 (*F. poae*)、*F. pseudograminearum*、接骨木镰刀菌 (*F. sambucinum*)、藤草镰刀菌 (*F. scirpi*)、半裸镰刀菌 (*F. semitectum*)、茄病镰刀菌 (*F. solani*)、拟枝孢镰刀菌 (*F. sporotrichoides*)、*F. langsethiae*、胶孢镰刀菌 (*F. subglutinans*)、三线镰孢菌 (*F. tricinctum*)、串珠镰刀菌 (*F. verticillioides*) 和其他, 也可以由曲霉属各种 (*Aspergillus spec.*)、青霉菌属各种 (*Penicillium spec.*), 如扩展青霉 (*P. expansum*), 指状青霉 (*P. digitatum*), 意大利青霉 (*P. italicum*)、黑麦麦角菌 (*Claviceps purpurea*)、葡萄状穗霉属各种 (*Stachybotrys spec.*)、白地霉 (*Geotrichum candidum*) 和其他产生。

[0122] 应用实施例

[0123] 实施例 1: 苹果黑星病 / 苹果

[0124] 储存水果的苹果黑星病控制

[0125] 本实施例示例了根据本发明组合物在苹果上对抗苹果黑星病的效果。黑星菌属也影响梨。

[0126] 田间试验在 2010 年在德国的苹果园中实施, 以评估化合物 (I-1) 对抗苹果黑星菌

的性能,所述苹果黑星病属于在苹果生长季节产生而且潜伏在水果上并且在存储条件下发展的一类病害。

[0127] 含有 200g/L 化合物 (I-1) 的典型的杀真菌制剂通过 7 次连贯的叶面喷洒在 2010 年被施用,从四月初的开花期,直到 2010 年六月 (最后的施用在 2010 年 6 月 6 日) 的早期水果生长阶段 (10mm 直径)。所述试验根据标准的实验操作进行。采收后,在 9 月 28 日将非染病的水果存储在冷库中。在 2011 年 1 月进行病害评定,在长期的存储之后评价化合物 (I-1) 的施用效果。

[0128] 当以 100 至 200g ai/ha/mch (=活性成分 / 公顷 / 米冠高) 的比率施用时,在第 7 次喷洒后 236 天,水果上苹果黑星病发病率的评价结果证明了组合物的效力。

[0129] 在德国 2010 年的一个试验结果:水果上的苹果黑星病发病率 (苹果)

[0130] (存储后未处理的地块中水果上 79.2% 的发病率)

[0131]

组成	比率 ai/ha/mch	%水果上的效果 (Abbott)
(I-1) 200SC	100	57
(I-1) 200SC	150	76
(I-1) 200SC	200	81

[0132] 实施例 2:盘长孢属 / 苹果

[0133] 储存水果的盘长孢属病害控制

[0134] 本实施例示例了根据本发明组合物在苹果上对抗盘长孢属病害的效果。白盘长孢也侵染梨。

[0135] 田间试验在 2010 年在意大利的苹果园中实施,以评估化合物 (I-1) 对抗盘长孢属病害的性能,所述盘长孢属病害属于在存储条件下产生的一类病害。

[0136] 含有 200g/L 化合物 (I-1) 的典型的杀真菌制剂通过 3 次连贯的叶面喷洒在 2010 年被施用,从水果尺寸接近八月末的最终阶段 (70mm 直径) 直到九月末的中度成熟 (最后的施用在 2010 年 9 月 23 日,即在 2010 年 10 月 7 日采收前 2 周)。所述试验根据标准的实验操作进行。在 2011 年 1 月对采收的水果进行病害评定,在长期的存储之后评价化合物 (I-1) 的施用效果。

[0137] 当以 100 至 300g ai/ha/mch 的比率施用时,在第 3 次喷洒后 118 天,水果上盘长孢属病害的发病率的评价结果证明了组合物的效果。

[0138] 在意大利 2010 年的一个试验结果:水果上的盘长孢属病害的发病率 (苹果)

[0139] (存未处理的地块中水果上 42% 的发病率)

[0140]

组成	比率 ai/ha/mch	%水果上的效果 (Abbott)
(I-1) 200SC	100	81.6
(I-1) 200SC	200	84.8

(I-1) 200SC	300	94.4
-------------	-----	------

[0141] 实施例 3:烟煤病 (Gloeodes pomigna)/ 梨

[0142] 储存水果的烟煤病控制

[0143] 本实施例示例了根据本发明组合物在梨上对抗烟煤病的效果。烟煤病也影响苹果。

[0144] 田间试验在 2010 年在德国的梨园中实施,以评估化合物 (I-1) 对抗烟煤病的性能。烟煤病属于在存储条件下导致水果腐烂的一类病害。

[0145] 含有 200g/L 化合物 (I-1) 的典型的杀真菌制剂通过 2 次连贯的叶面喷洒在 2010 年被施用,从八月末的水果成熟初期阶段直到九月末的中度成熟(最后的施用在 2010 年 9 月 20 日,即在 2010 年 10 月 4 日采收前 2 周)。所述试验根据标准的实验操作进行。在 2011 年 1 月对采收的水果进行病害评定,在长期的存储之后评价化合物 (I-1) 的施用效果。

[0146] 当以从 100 至 300g ai/ha/mch 的比率施用,在第 2 次喷洒后 122 天,水果上的烟煤病发病率的评价结果证明了组合物提高的效果,在最高比率时其具有优异的保护作用。这种对抗烟煤病和其他病害的保护作用具有很高的价值,其明显地增加了可销售的水果。

[0147] 在德国 2010-1011 年的一个试验结果:水果上的烟煤病发病率(梨)

[0148] (未处理的地块中水果上 20.8%的发病率 -- 存储后未处理的地块中可上市水果上的 59.4%)

[0149]

组成	比率 ai/ha/mch	%水果上的效果 (Abbott)	%可上市水果 (未处理=100)
(I-1) 200 SC	100	38.3	131.7
(I-1) 200 SC	200	59.9	139.7
(I-1) 200 SC	300	80.1	154.4

[0150] 实施例 4:围小丛壳菌 / 芒果

[0151] 储存水果的围小丛壳菌病控制

[0152] 田间试验在 2010 年在巴西的芒果园中实施,以评估化合物 (I-1) 对抗围小丛壳菌病的性能,所述围小丛壳菌病属于在存储条件下产生的一类病害。

[0153] 含有 200g/L 化合物 (I-1) 的典型的杀真菌制剂通过 4 次连贯的叶面喷洒在 2010 和 2011 年被施用,从 2010 年 11 月初的水果尺寸 10mm 的直径直到 2011 年 1 月初的早期成熟(最后的施用在 2011 年 1 月 4 日,在 2011 年 1 月 20 日采收水果)。所述试验根据标准的实验操作进行。在 2011 年 1 月对采收的水果进行病害评定,在长期的存储之后评价化合物 (I-1) 的施用效果。

[0154] 当以从 25 至 75g ai/hl\* 的比率施用,在第 4 次喷洒后 24 天,水果上围小丛壳菌病严重度 (severity) 的评价结果证明了组合物提高的效果。

[0155] 巴西 2010 年的一个试验结果:水果上发生的围小丛壳菌病的严重度(芒果)

[0156] (未处理的地块中水果上 31%的严重度)

[0157]

组成	比率 gai/hl*	%水果上的效果 (Abbott)
(I-1) 200SC	25	40.2
(I-1) 200SC	50	55.4
(I-1) 200SC	75	68.5

[0158] (\*) 克活性成分 / 百公升 - 施用在 2000l/ha 实现。