



(12) **Øversettelse av  
europeisk patentskrift**

(11) **NO/EP 2193716 B1**

**NORGE**

(19) NO  
(51) Int Cl.  
**A01N 43/56 (2006.01)**

**Patentstyret**

---

- (21) Øversettelse publisert 2011.06.14
- (80) Dato for Den Europeiske Patentmyndighets publisering av det meddelte patentet: 2011.02.16
- (86) Europeisk søknadsnr: 10157578.5
- (86) Europeisk innleveringsdag 2008.04.23
- (87) Den europeiske søknadens Publiseringsdato 2010.06.09
- (30) Prioritet 2007.04.25 EP 07008370
- (84) Utpekte stater AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MT NL NO PL PT RO SE SI SK TR  
Utpekte samarbeidende stater AL BA MK RS
- (62) Avdelt fra EP2150113, med inndato 2008.04.23
- (73) Innehaver Syngenta Participations AG, Schwarzwaldallee 2154058 Basel, Sveits
- (72) Oppfinner Tobler, Hans, Birsigstrasse 1294054, Basel, CH-Sveits  
Walter, Harald, Syngenta Crop Protection M¼nchwilen AG, Schaffhau4332, Stein, Sveits  
Haas, Ulrich Johannes, Syngenta Crop Protection M¼nchwilen AG, Schaffhau4332, Stein, Sveits
- (74) Fullmektig Zacco Norway AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

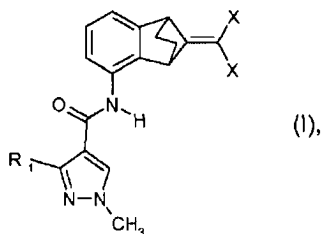
- 
- (54) Benevnelse **Soppdrepende sammensetninger**
- (56) Anfrte publikasjoner WO-A-2004/035589 B1, WO-A1-2007/048556 B1, WO-A-2006/037632 B1

Den foreliggende oppfinnelse vedrører nye soppdrepende sammensetninger som er egnet for bekjempelse av sykdommer forårsaket av plantepatogener, særlig plantepatogene sopper, samt en fremgangsmåte for bekjempelse av sykdommer på nytteplanter, spesielt rustsykdommer på soyaplanter.

5

Fra WO 04/35589 og WO 06/37632 er det kjent at visse trisykliske aminderivater og blandinger som omfatter nevnte aminderivater har biologisk aktivitet mot plantepatogene sopper. På den annen side er ulike soppdrepende forbindelser tilhørende forskjellige kjemiske klasser velkjent som soppdrepende midler for planter beregnet for anvendelse på forskjellige kulturplanteavlinger. Avlingens toleranse overfor og aktivitet mot plantepatogene bladsopper tilfredsstillende imidlertid ikke alltid jordbrukets behov i mange tilfeller og aspekter. For eksempel var det ikke tidligere kjent noen plantepatogener av økonomisk betydning i de viktigste områder for soyaavlinger. I den siste tiden har det imidlertid vært en økning i alvorlige rustinfeksjoner i soyaavlinger i Sør-Amerika av den skadelige soppen *Phakopsora pachyrhizi* som har medført vesentlige avlingsstap. De fleste vanlige soppdrepende midler er uegnet for bekjempelse av rust i soyabønner eller deres virkning mot *Phakopsora pachyrhizi* er utilfredsstillende.

På grunn av jordbrukets forannevnte behov for en avlings økte toleranse overfor og/eller aktivitet mot plantepatogene sopper, slik som *Phakopsora pachyrhizi*, foreslås det derfor ifølge den foreliggende oppfinnelse en ny sammensetning egnet for bekjempelse av sykdommer forårsaket av plantepatogener som omfatter en sammensetning egnet for bekjempelse av sykdommer forårsaket av plantepatogener som omfatter  
(A) en forbindelse med formel (I)



30

hvor  $R_1$  er difluormetyl eller trifluormetyl og X er klor, fluor eller brom; og  
(B) fludioxonil.

Det er blitt funnet at anvendelsen av komponent (B) i kombinasjon med komponent (A) øker overraskende og betydelig effektiviteten av sistnevnte mot sopper, og omvendt. I tillegg er fremgangsmåten ifølge oppfinnelsen virksom mot et bredere spektrum av slike sopper enn det som kan bekjempes med de aktive bestanddeler i

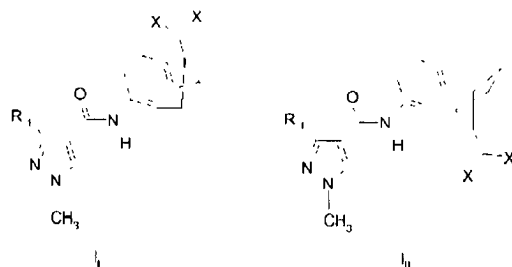
5 følge denne fremgangsmåten når de anvendes alene.

Et ytterligere aspekt ifølge den foreliggende oppfinnelse er en fremgangsmåte for å bekjempe sykdommer på nytteplanter eller på formeringsmateriale av disse som er forårsaket av plantepatogener, som omfatter å påføre nytteplantene, deres

10 voksested eller deres formeringsmateriale, en sammensetning ifølge oppfinnelsen. Foretrukket er en fremgangsmåte som omfatter å påføre nytteplantene eller deres voksested en sammensetning ifølge oppfinnelsen, og mer foretrukket er å påføre den på nytteplantene. Ytterligere foretrukket er en fremgangsmåte som omfatter å påføre nytteplantenes formeringsmateriale en sammensetning ifølge oppfinnelsen.

15

Forbindelsene med formel I forekommer i to forskjellige stereoisomerer som er beskrevet som de enkelte enantiomerer med formlene I<sub>I</sub> og I<sub>II</sub>:



20

Oppfinnelsen omfatter alle slike stereoisomerer og blandinger derav i ethvert forhold. Ifølge oppfinnelsen betyr "racemisk forbindelse med formel (I)" en racemisk blanding av forbindelser med formel I<sub>I</sub> og I<sub>II</sub>.

En foretrukket utførelsesform av oppfinnelsen er representert av de

25 sammensetningene som omfatter som komponent (A) en forbindelse med formel (I), hvor R<sub>1</sub> er difluormetyl. Ytterligere foretrukne forbindelser med formel (I) er: 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre (9-diklormetyliden-benzonorboren-5-yl)amid (forbindelse A-1.1); 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre (9-difluormetyliden-benzonorboren-5-yl)amid (forbindelse A-1.2);

30 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre (9-dibrommetyliden-benzonorboren-5-yl)amid (forbindelse A-1.3).

Benevnelsen av substituent X som klor, fluor eller brom betyr at begge substituenter X har samme betydninger.

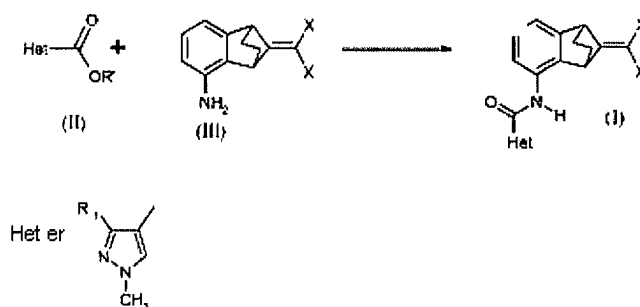
- 5 En foretrukket utførelsesform av oppfinnelsen er representert av forbindelsene som omfatter som komponent (A) en forbindelse med formel (I), hvor  $R_1$  er trifluormetyl. Ytterligere foretrukne forbindelser med formel (I) er:
- 1-metyl-3-trifluormetyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre (9-diklormetyliden-benzonorbornen-5-yl)amid (forbindelse A-1.4);
- 10 1-metyl-3-trifluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre (9-difluormetyliden-benzonorbornen-5-yl)amid (forbindelse A-1.5);
- 1-metyl-3-trifluormetyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre (9-dibrommetyliden-benzonorbornen-5-yl)amid (forbindelse A-1.6).
- 15 Særlig foretrukne forbindelser ifølge oppfinnelsen omfatter som komponent (A) en forbindelse valgt fra 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre (9-diklormetyliden-benzonorbornen-5-yl)amid (forbindelse A-1.1) og 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre (9-difluormetyliden-benzonorbornen-5-yl)amid (forbindelse A-1.2) og som komponent (B) fludioxonil.
- 20 Ytterligere særlig foretrukne forbindelser ifølge oppfinnelsen omfatter som komponent (A) forbindelsen 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre (9-diklormetyliden-benzonorbornen-5-yl)amid (forbindelse A-1.1) og som komponent (B) fludioxonil.
- Ytterligere særlig foretrukne forbindelser ifølge oppfinnelsen omfatter som
- 25 komponent (A) forbindelsen 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre (9-difluormetyliden-benzonorbornen-5-yl)amid (forbindelse A-1.2) og som komponent (B) fludioxonil.

Forbindelsen med formel (I) kan fremstilles som beskrevet nedenfor med

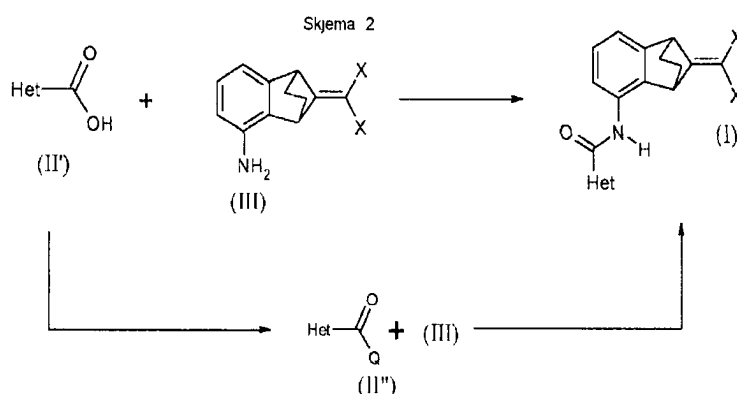
30 henvisning til reaksjonsskjemaene 1 til 3.

4

Skjema 1



Som det fremgår fra skjema 1 kan en forbindelse med formel (I), hvor  $\text{R}_1$  og  $\text{X}$  er som definert ovenfor, syntetiseres ved å reagere en forbindelse med formel (II), hvor  $\text{R}_1$  er som definert ovenfor og  $\text{R}'$  er  $\text{C}_{1-5}$  alkyl, med en anilin-forbindelse med formel (III), hvor  $\text{X}$  er som definert ovenfor, i nærvær av  $\text{NaN}(\text{TMS})_2$  ved  $-10^\circ\text{C}$  til omgivelsestemperatur, fortrinnsvis i tørr THF, som beskrevet av J.Wang et al, *Synlett*, 2001, 1485.

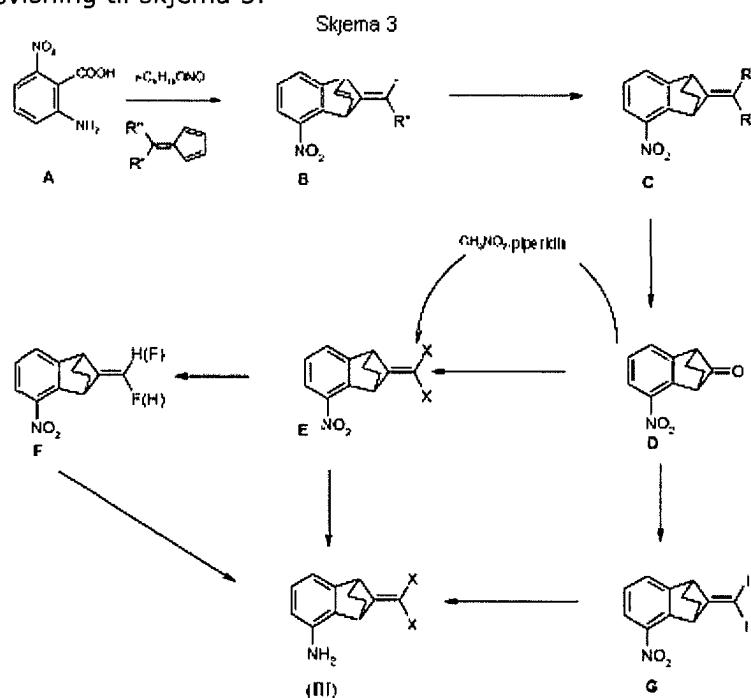


10

Alternativt, som det fremgår fra skjema 2, kan en forbindelse med formel (I), hvor  $\text{Het}$  er som definert i skjema 1,  $\text{R}_1$  og  $\text{X}$  er som definert ovenfor, fremstilles ved å reagere en forbindelse med formel (II'), hvor  $\text{Het}$  er som definert ovenfor, med en anilin-forbindelse med formel (III), hvor  $\text{X}$  er som definert ovenfor, i nærvær av et aktiverende middel, som BOP-Cl (bis-(2-okso-3-oxalolidinyl)-fosfinsyre), og to ekvivalenter av en base, som trietylamin, i et løsemiddel, slik som diklormetan (som beskrevet for eksempel av J. Cabré et al., *Synthesis* 1984, 413) eller ved å reagere en forbindelse med formel (II''), hvor  $\text{Het}$  er som definert ovenfor og  $\text{Q}$  er klor, fluor eller brom, med en anilin-forbindelse med formel (III), hvor  $\text{X}$  er som definert ovenfor, i nærvær av én ekvivalent av en base, som trietylamin eller

natrium- eller kaliumkarbonat eller -bikarbonat, i et løsemiddel, som diklormetan, etylacetat eller N,N-dimetylformamid, fortrinnsvis ved  $-10^{\circ}\text{C}$  til  $30^{\circ}\text{C}$ . Forbindelsen med formel (II'') oppnås fra en forbindelse med formel (II') ved behandling med et halogenerende middel som tonylchlorid, tonylbromid, oksalyklorid, fosgen,  $\text{SF}_4/\text{HF}$ ,  
 5 DAST (dietyl amino)svovel-trifluorid), eller Deoxo-Fluor® ([bis(2-metoksyetyl)amino]svovel-trifluorid) i et løsemiddel som toluen, diklormetan eller acetonitril.

Forbindelsene (II) og (II') er alminnelig kjente forbindelser og kan fremstilles som  
 10 beskrevet i den kjemiske litteraturen eller skaffes fra kommersielle kilder. Forbindelsen (III) er en ny forbindelse og kan fremstilles som beskrevet med henvisning til skjema 3.



Som vist i skjema 3 kan forbindelsen med formel (III) fremstilles ved en *Bechamp*  
 15 reduksjon eller ved andre etablerte fremgangsmåter, for eksempel ved selektiv katalytisk hydrogenering av nitro-forbindelsene (E), (F) og (G).

De 9-dihalometylidene-5-nitro-benzonorbornen-forbindelsene (E), hvor X er klor, brom eller fluor, kan oppnås ved *Wittig*-olefineringen av ketonene (D) med  
 20 dihalometylidenefosforaner  $\text{R}'''_3\text{P}=\text{C}(\text{R}^4)\text{R}^5$  genererte *in situ*, hvor  $\text{R}'''$  er trifenyl,  $\text{triC}_{1-4}$  alkyl eller tridimetylamin og X er halogen, i henhold til eller i analogi med prosedyrene beskrevet av H.-D. Martin et al, *Chem. Ber.* 118, 2514 (1985), S.

Hayashi et al, *Chem. Lett.* 1979, 983, eller M. Suda, *Tetrahedron Letters*, 22, 1421 (1981).

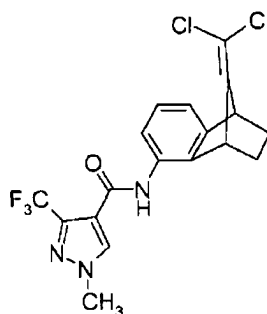
Forbindelser med formel (I) kan oppnås som beskrevet i eksemplene H1 til H7.

5

### **EKSEMPEL 1**

Dette eksemplet viser fremstillingen av 1-metyl-3-trifluormetyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre (9-diklormetylidene-benzonorbornen-5-yl)amid (forbindelse A-1.4):

10



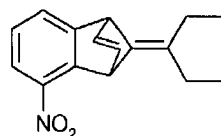
9-diklormetylen-5-amino-benzonorbornen (175 mg, 0,729 mmol, fremstilt som  
 15 beskrevet i eksempel 6) i diklormetan (10 ml) ble reagert med 1-metyl-3-trifluormetyl-1H-pyrazol-karboksylysyre (170 mg, 0,874 mmol, 1,2 ekv.) i nærvær av bis-(2-okso-3-oksazolidiyl)-fosfinsyre-klorid (278 mg, 1,09 mmol, 1,5 ekv.) og trietylamin (184 mg, 1,821 mmol, 2,5 ekv.) ved omgivelsestemperatur under omrøring i 23 timer. Reaksjonsblandingen ble ekstrahert med mettet  
 20 natriumbikarbonatsløsning og mettet saltlake, tørket over Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> og renset på silikagel i etylacetat-heksan-(1:1). 210 mg (69 % av teori) av 1-metyl-3-trifluormetyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre (9-diklormetylidene-benzonorbornen-5-yl)amid (forbindelse A-1.4, smp. 179-181°C) ble oppnådd.

25

### **EKSEMPEL 2**

Dette eksemplet viser fremstillingen av 9-(3-pentyliden)-5-nitro-benzonorbornadien:

7

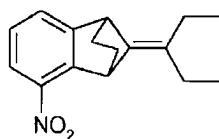


Til en godt blandet løsning av isopentylnitritt (2,31 ml, 1,3 ekv.) i dimetoksyetan (50 ml) ved 58°C ble en blanding av 6-nitroantranilsyre (2,76g, 1 ekv.) og 6,6-dietyfulven (6,45 g av 79% renhet, 2,5 ekv.) oppløst i 25 ml av dimetoksyetan  
 5 tilsatt dråpevis innen 8 minutter mens temperaturen steg til 67°C. Etter 30 minutter ble den mørke reaksjonsblandingen fordampet og rensset på silikagel i heksan-etylacetat-(20:1) for å gi 3,02 g (78 %) av det ønskede produktet som en olje som størknet ved romtemperatur (smp. 60-61°C).

10

### **EKSEMPEL 3**

Dette eksemplet viser fremstillingen av 9-(3-pentyliden)-5-nitro-benzonorbornen:

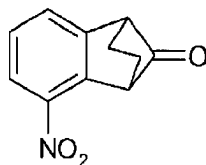


9-(3-pentyliden)-5-nitro-benzonorbornadien (7,97g fremstilt som beskrevet i  
 15 eksempel 2) i THF (70 ml) ble hydrogenert ved 20°C i nærvær av Rh(PPh<sub>3</sub>)<sub>3</sub>Cl (Wilkinsons katalysator, 0,8 g). Reaksjonen opphørte etter opptak av én ekvivalent av hydrogen. Fordampning og filtrering av råstoffet på silikagel i etylacetat-heksan-(100:2) resulterte i det ønskede produktet som en olje (7,90 g) som størknet ved å stå i romtemperatur (smp. 69-56°C).

20

### **EKSEMPEL 4**

Dette eksemplet viser fremstillingen av 9-okso-5-nitro-benzonorbornen:



25 9-(3-pentyliden)-5-nitro-benzonorbornen (7,0g, 27,2 mmol; fremstilt som beskrevet i eksempel 3) oppløst i diklormetan (300 ml) og metanol (5 ml) ble ozonisert (2,8 l O<sub>2</sub>/min, 100 W, tilsvarende 9,7 g O<sub>3</sub>/t) ved - 70°C til en vedvarende blå farge ble observert (etter ca. 15 minutter). Reaksjonsblandingen ble spylt med nitrogen gass. Trifenylfosfin (8,4 g, 32,03 mmol, 1,18 ekv.) ble tilsatt

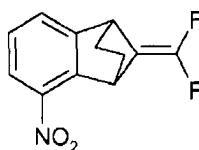


og temperaturen ble tillatt å varme opp til 20-25°C. Etter fordampning av løsemiddelet ble residuet rensset på silikagel i heksan-EtOAc3:1 for å gi 5,2 g av forbindelse 36,01 (smp. 112-114°C).

5

**EKSEMPEL 5**

Dette eksemplet viser fremstillingen av 9-difluormetyliden-5-nitro-benzonorbornen:

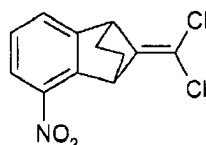


Til en løsning av dibromdifluormetan (6,30 g, 30 mmol) ved 0°C i THF (50 ml) ble tris-(dimetylamino)-fosfan (10,1 g ved 97 %, ekvivalent til 11,2 ml, 60 mmol) i THF (30 ml) tilsatt innen 20 minutter. Til den resulterende suspensjon, etter omrøring i 1 time ved romtemperatur ble det tilsatt dråpevis en løsning av 9-okso-5-nitro-benzonorbornen (6,10 g, 30 mmol; fremstilt som beskrevet i eksempel 4) i THF (20 ml) innen 25 minutter etterfulgt av omrøring i 21 timer. Suspensjonen ble hullet på isvann og ekstrahert med etylacetat. Rensingen på silikagel i etylacetat-heksan- (1:4) ga 4,675 g av 9-difluormetyliden-5-nitro-benzonorbornen (smp. 99-101°C).

20

**EKSEMPEL 6**

Dette eksemplet viser fremstillingen av 9-diklormetyliden-5-nitro-benzonorbornen:

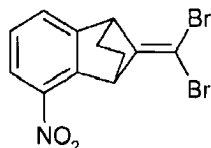


Tørt karbontetraklorid (5,9 g, 33 mmol) ble reagert med trifenyfosfin (14,46 g, 55,1 mmol) i diklormetan (30 ml) ved romtemperatur i 1 time. 9-okso-5-nitro-benzonorbornen (5,60 g, 27,56 mmol; fremstilt som beskrevet i eksempel 4) i diklormetan (10 ml) ble tilsatt dråpevis og omrørt i 20 timer ved romtemperatur. Etter vandig opparbeidelse (isvann) og ekstrahering med diklormetan, ble råproduktet rensset på silikagel i etylacetat-heksan-(1:4) for å oppnå det ønskede 9-diklormetyliden-5-nitro-benzonorbornen (1,83 g; smp. 136-137°C). En del av utgangsmaterialet (4,06 g) ble gjenvunnet.

30

**EKSEMPEL 7**

Dette eksemplet viser fremstillingen av 9-dibrommetyliden-5-nitro-benzonorbornen:



5

Karbondetribromid (4,66 ved 98 %, 13,8 mmol) ble reagert under omrøring med trifenylyfosfin (7,23 g, 27,6 mmol) i diklormetan (50 ml) i 50 minutter ved romtemperatur. 9-okso-5-nitro-benzonorbornen (2,8 g, 13,8 mmol; fremstilt som beskrevet i eksempel 4) i diklormetan (10 ml) ble tilsatt dråpevis og omrørt over natten ved romtemperatur. Vandig opparbeidelse (isvann) og ekstrahering med diklormetan etterfulgt av søylekromatografi (etylacetat-heksan-(1:9) av råproduktet ga det ønskede produktet 9-dibrommetyliden-5-nitro-benzonorbornen (2,1 g; smp. 153 – 155°C).

15

### **Tabell 1**

Tabell 1 viser smeltepunkt og NMR-data, alle med  $\text{CDCl}_3$  som løsemiddel, med mindre annet er oppgitt, for forbindelser med formel (I). I tabellen er temperaturer oppgitt i grader Celsius, "NMR" betyr nukleær magnetisk resonans spektrum og følgende forkortelser brukes:

20

smp. -	smeltepunkt	kp. =	kokepunkt
s =	enkelt	br =	bred
d =	dublett	dd =	dublett av dublettene
t =	triplett	q =	kvertett
m =	multipltett	ppm =	deler per million
THF =	tetrahydrofuran		
<b>Forbindelse</b>	<b>smp. (°C)</b>	<b><math>^1\text{H-NMR}</math> protonskift <math>\delta</math> (ppm) (<math>\text{CDCl}_3</math>)</b>	
A-1.1	179-181	8,06 (s,1H), 7,69 (d overlappet av brd signal, utbyttbar med $\text{D}_2\text{O}$ , 2H), 7,18 (t,1H), 7,06 (d,1H), 4,00 (s,3H), 3,96 (m, 2H), 2,12 (m, 2H), 1,51 (m,1H), 1,39 (m,1H).	
A-1.2	137-143	8,06 (s,1H), 7,68 (brd, utbyttbar med $\text{D}_2\text{O}$ ,1H), 7,67 (d,1H), 7,14 (d,1H), 4,00 (s,3H), 3,94 (m,2H), 2,06	

		(m,2H), 1,48 (m,1H), 1,36 (m,1H).
A-1.3	198-200	8,06 (s,1H), 7,71 (d,h), 7.68 (brd, utbyttbar med D <sub>2</sub> O, 1H), 7,18 (t,1H), 7,05 (d,1H), 4,00 (s,3H), 3,95 (m,1H), 3,93 (m,1H), 2,12 (m,2H), 1,50 (m,1H), 1,38 (m,1H).
A-1.4	183-188	7,78 (d,1H), 7,70 (brd, utbyttbar med D <sub>2</sub> O,1H), 7,39 (brd s, 1H), 7,16 (t,1H), 7,01 (d overlappet av brd s, 2H), 4,00 (m,1H), 3,94 (m,1H), 3,72 (s,3H), 2,10 (m,2H), 1,51 (m,1H), 1,38 (m,1H).
A-1.5	133-135	7,76 (d,1H), 7.70 (brd, utbyttbar med D <sub>2</sub> O,1H), 7,39 (brd s,1H), 7,13 (t,1H), 7,01 (brd s,1H), 7,00 (d,1H), 3,98 (m, 1H), 3,93 (m,1H), 3,72 (s,3H), 2,04 (m,2H), 1,49 (m,1H), 1,36 (m,1H).
A-1.6	155-158	7,79 (d,1H), 7,70 (brd, utbyttbar med D <sub>2</sub> O,1H), 7,39 (brd s,1H), 7,17 (t,1H), 7,02 (d,1H), 7,01 (brd s,1H), 3,98 (m,1H), 3,91 (m,1H), 3,72 (s,3H), 2,11 (m,2H), 1,50 (m,1H), 1,39 (m,1H).

Komponenten (B) er kjent og beskrevet i "The Pesticide Manual" [The Pesticide Manual - A World Compendium; 13. utgave; red.: C.D.S. Tomlin; The British Crop Protection Council] under oppslagsnummer (368).

5

Gjennom hele dette dokumentet betyr uttrykket "sammensetning" de forskjellige blandinger eller kombinasjoner av komponentene (A) og (B), for eksempel i en enkel "ferdig-blandet" form, i en kombinert sprøyteblanding sammensatt av separate formuleringer av de enkelte aktive bestanddeler, som en "tank-blanding", og i en kombinert bruk av de enkelte aktive bestanddeler når disse er påført fortløpende, dvs. den ene etter den andre med et ganske kort tidsintervall, som noen få timer eller dager. Rekkefølgen som komponentene (A) og (B) er påført i er ikke vesentlig for å kunne utføre den foreliggende oppfinnelse.

- 15 Sammensetningene ifølge oppfinnelsen er virksomme mot skadelige mikroorganismer som mikroorganismer som forårsaker plantepatogene sykdommer, og særlig mot plantepatogene sopper og bakterier.

20 Sammensetningene ifølge oppfinnelsen er effektive særlig mot plantepatogene sopper som tilhører følgende klasser: Ascomycetes (f.eks. Venturia, Podosphaera, Erysiphe, Monilinia, Mycosphaerella, Uncinula); Basidiomycetes (f. eks. slekten Hemileia, Rhizoctonia, Phakopsora, Puccinia, Ustilago, Tilletia); Fungi imperfecti (også kjent som Deuteromycetes; f.eks. Botrytis, Helminthosporium, Rhynchosporium, Fusarium, Septoria, Cercospora, Alternaria, Pyricularia og

Pseudocercospora); Oomycetes (f.eks. Phytophthora, Peronospora, Pseudoperonospora, Albugo, Bremia, Pythium, Pseudosclerospora, Plasmodium).

Ifølge oppfinnelsen omfatter "nytteplanter" typisk følgende plantearter: vinstokker; 5 kornsorter som hvete, bygg, rug eller havre; betes som sukkerroe eller bladbeta; frukter som eplefrukter, steinfrukter eller bærfrukter, for eksempel epler, pærer, plommer, ferskener, mandler, kirsebær, jordbær, bringebær eller bjørnebær; belgfrukter som bønner, linser, erter eller soyabønner; oljeplanter som raps, sennep, valmue, oliven, solsikke, kokosnøtt, ricinusplanter, kakaobønner eller 10 jordnøtter; agurkplanter som marggresskar, agurker eller meloner; fiberplanter som bomull, lin, hamp eller jute; sitrusfrukter som appelsiner, sitroner, grapefrukt eller mandariner; grønnsaker som spinat, salat, asparges, kål, gulrøtter, løk, tomater, poteter, saftfrukter eller paprika; laurbærfamilien som avokadoer, kanel eller kamfer; mais; tobakk; nøtter; kaffe, sukkerrør; te; ranker; humler; durian; 15 bananer; naturlige gummiplanter; gresstorv eller pryddplanter som blomster, prydbusker, løvtrær eller eviggrønne trær, for eksempel nåletrær. Denne listen representerer på ingen måte en begrensning.

Uttrykket "nytteplanter" skal forstås å omfatte også nytteplanter som er gjort 20 tolerante overfor ugressmidler som bromoksynil eller klasser av ugressmidler (som for eksempel HPPD-hemmere, ALS-hemmere, for eksempel primisulfuron, prosulfuron og trioksysulfuron, EPSPS (5-enol-pyrovyl-shikimat-3-fosfat-syntase)-hemmere, GS (glutamin syntetase)-hemmere eller PPO (protoporfyrinogen-oksidas)-hemmere) som følge av tradisjonelle avlings- eller genteknologiske 25 metoder. Et eksempel på en nyttevekst som er gjort tolerant overfor imidazolinoner, f. eks. imazamoks, ved tradisjonelle avlingsmetoder (mutagenese) er Clearfield® sommerraps (Canola). Eksempler på nyttevekster som er gjort tolerante overfor ugressmidler eller klasser ugressmidler ved genteknologiske metoder inkluderer glyfosat- og glyfosinat-resistente maistyper som er tilgjengelige 30 på markedet under merkenavnene RoundupReady®, Herculex® og LibertyLink®.

Uttrykket "nytteplanter" skal forstås å omfatte også nytteplanter som har vært transformert ved bruk av rekombinante DNA-teknikker slik at de er i stand til å 35 syntetisere én eller flere selektivt virkende toksiner, slik som er kjent fra for eksempel toksin-produserende bakterier, særlig de som er av Bacillus-slekten.

Uttrykket "nytteplanter" skal forstås å omfatte også nytteplanter som har vært transformert ved bruk av rekombinante DNA-teknikker slik at de er i stand til å syntetisere antipatogene stoffer med en selektiv virkning, som for eksempel de såkalte "patogeneserelaterte proteiner" (PRPs, se for eksempel EP-A-0 392 225).

5 Eksempler på slike antipatogene stoffer og transgene planter som kan syntetisere slike antipatogene stoffer er for eksempel kjent fra EP-A-0 392 225, WO 95/33818 og EP-A-0 353 191. Fremgangsmåtene for fremstilling av slike transgene planter er alminnelig kjent for fagmannen og er beskrevet for eksempel i de forannevnte dokumentene.

10

Uttrykket "voksested" til en nytteplante som brukt her skal omfatte det stedet hvor nytteplantene vokser, hvor planteformeringsmateriale til nytteplantene er sådd eller hvor planteformeringsmateriale til nytteplantene skal plasseres i jorden. Et eksempel på et slikt voksested er en åker hvor nyttevekster vokser.

15

Uttrykket "planteformeringsmateriale" forstås å betegne generative deler av planten, som frø, som kan brukes for formering av sistnevnte, og vegetativt materiale, som stiklinger eller rotknoller, for eksempel poteter. Det kan nevnes for eksempel frø (i ordets egentlige forstand), røtter, frukter, rotknoller, løker, 20 rotstokker og deler av planter. Spirende planter og unge planter som skal omplantes etter spiring eller etter å ha kommet opp fra jorden kan også nevnes. Disse unge plantene kan beskyttes før omplantning ved en fullstendig eller delvis behandling ved neddypping. Fortrinnsvis forstås "planteformeringsmateriale" å betegne frø.

25

Sammensetningene ifølge den foreliggende oppfinnelse kan også brukes innen beskyttelse av lagringsvarer mot soppangrep. Ifølge den foreliggende oppfinnelse forstås uttrykket "lagringsvarer" å betegne naturlige stoffer av vegetabilsk og/eller animalsk opprinnelse og deres bearbeidede former som har blitt hentet fra den 30 naturlige livssyklus og som det ønskes langvarig beskyttelse for. Lagringsvarer av vegetabilsk opprinnelse, som planter eller deler derav, for eksempel stilker, blad, rotknoller, frø, frukter eller korn kan beskyttes i nyhøstet tilstand eller i bearbeidet form, som fortørket, fuktet, finfordelt, oppmalt, presset eller ristet. Også omfattet av definisjonen av lagringsvarer er tømmer, uansett om det er i form av råttømmer, 35 som konstruksjonstømmer, høyspenningsmaster og barrierer, eller i form av ferdiglagde artikler som møbler eller gjenstander laget av tre. Lagringsvarer av animalsk opprinnelse er hud, skinn, pels, hår og lignende. Sammensetningene

ifølge den foreliggende oppfinnelse kan forhindre ugunstige påvirkninger som forråtnelse, misfarging eller mugg.

5 Fortrinnsvis forstås "lagringsvarer" å betegne naturlige stoffer av vegetabilsk opprinnelse og /eller deres bearbeidede former, mer foretrukket frukter og deres bearbeidede former, som eplefrukter, steinfrukter, bærfrukter og sitrusfrukter og deres bearbeidede former. I en annen foretrukket utførelsesform av oppfinnelsen forstås "lagringsvarer" å betegne tre.

10 Følgelig er en ytterligere aspekt av den foreliggende oppfinnelse en fremgangsmåte for beskyttelse av lagringsvarer som omfatter å påføre lagringsvarene en sammensetning ifølge oppfinnelsen.

15 Sammensetningene ifølge den foreliggende oppfinnelse kan brukes også innen beskyttelse av teknisk materiale mot soppangrep. Ifølge den foreliggende oppfinnelse omfatter uttrykket "teknisk materiale" papir; tepper; strukturer; kjøle- og varmesystemer; bygningsplater; ventilasjons- og luftkondisjoneringsystemer og lignende. Fortrinnsvis forstås "teknisk materiale" å betegne bygningsplater. Sammensetningene ifølge den foreliggende oppfinnelse kan forhindre ugunstige påvirkninger som forråtnelse, misfarging eller mugg.

Sammensetningene ifølge den foreliggende oppfinnelse er særlig effektive mot meldugg; rust; bladflekksykdommer; tørrflekksyke og muggtyper; særlig mot Septoria Puccinia, Erysiphe, Pyrenophora og Tapesia i kornsorter; Phakopsora i soyabønner; Menileia i kaffe; Phragmidium i roser; Alternaria i poteter, tomater og saftfrukter; Sclerotinia i gresstov, grønnsaker, solsikke og raps; svartråte, rød rotråte, meldugg, gråskimmel og "deadarm"-syke i ranker; Botrytis cinerea i frukter; Monilinia spp. i frukter og Penicillium spp. i frukter.

30 Sammensetningene ifølge oppfinnelsen er videre særlig effektive mot frøbårne og jordbårne sykdommer som Alternaria spp., Ascochyta spp., Botrytis cinerea, Cercospora spp., Claviceps purpurea, Cochliobolus sativus, Colletotrichum spp., Epicoccum spp., Fusarium graminearum, Fusarium moniliforme, Fusarium oxysporum, Fusarium proliferatum, Fusarium solani, Fusarium subglutinans, 35 Gaumannomyces graminis, Helminthosporium spp., Microdochium nivale, Phoma spp., Pyrenophora graminea, Pyricularia oryzae, Rhizoctonia solani, Rhizoctonia cerealis, Sclerotinia spp., Septoria spp., Sphacelotheca reilliana, Tilletia spp.,

Typhula incarnata, Urocystis occulta, Ustilago spp. eller Verticillium spp.; særlig mot patogene av korn som hvete, bygg, rug eller havre; mais; ris; bomull; soya; gresstorv; sukkerroe; raps; poteter; belgplanter som erter, linser eller bukkeerter; og solsikke.

5

Sammensetningene ifølge oppfinnelsen er dessuten særlig effektive mot etterinnhøstingssykdommer som Botrytis cinerea, Colletotrichum musae, Curvularia lunata, Fusarium semitectum, Geotrichum candidum, Monilinia fructicola, Monilinia fructigena, Monilinia laxa, Mucor piriformis, Penicillium italicum, Penicillium solitum, Penicillium digitatum eller Penicillium expansum særlig mot patogene av frukter som eplefrukter, for eksempel epler og pærer, steinfrukter, for eksempel fersken og plommer, sitrus, meloner, papaya, kiwi, mango, bær, for eksempel jordbær, avokadoer, granatepler og bananer, samt nøtter.

15 Sammensetningene ifølge oppfinnelsen er særlig anvendbare for å bekjempe følgende sykdommer på følgende nyttevekster:

Alternaria-arter i frukt og grønnsaker; Ascochyta-arter i belgplanter; Botrytis cinerea i jordbær, tomater, solsikke, belgplanter, grønnsaker og druer, som Botrytis cinerea på druer; Cercospora arachidicola i peanøtter; Cochliobolus sativus i kornsorter; Colletotrichum-arter i belgplanter; Erysiphe-arter i kornsorter, som Erysiphe graminis på hvete og Erysiphe graminis på bygg; Erysiphe cichoracearum og Sphaerotheca fuliginea i saftfrukter; Fusarium-arter i kornsorter og mais; Gäumannomyces graminis i kornsorter og gressplener; Helminthosporium-arter i mais, ris og poteter; Hemileia vastatrix på kaffe; Microdochium-arter i hvete og rug; Mycosphaerella fijiensis i bananer; Phakopsora-arter i soyabønner, som Phakopsora pachyrizii i soyabønner; Puccinia-arter i kornsorter, bredbladete avlinger og flerårige planter; som Puccinia recondita på hvete, Puccinia striiformis på hvete og Puccinia recondita på bygg; Pseudocercospora-arter i kornsorter, som Pseudocercospora herpotrichoides i hvete; Phragmidium mucronatum i roser; Podospaera-arter i frukter; Pyrenophora-arter i bygg, som Pyrenophora teres på bygg; Pyricularia oryzae i ris; Ramularia collo-cygni i bygg; Rhizoctonia-arter i bomull, soyabønner, kornsorter, mais, poteter, ris og gressplener, som Rhizoctonia solani på potet, ris, gresstorv og bomull; Rhynchosporium secalis på bygg, Rhynchosporium secalis på rug; Sclerotinia-arter i gressplener, salat, grønnsaker og raps, som Sclerotinia sclerotiorum på raps og Sclerotinia homeocarpa på gresstorv; Septoria-arter i kornplanter, soyabønner og grønnsaker, som Septoria tritici på hvete, Septoria nodorum på hvete og Septoria glycines på soyabønner;

35

Sphacelotheca reilliana i mais; Tilletia-arter i kornsorter; Uncinula necator, Guignardia bidwellii og Phomopsis viticola i ranker; Urocystis occulta i rug; Uromyces-arter i bønner; Ustilago-arter i kornplanter og mais; Venturia-arter i frukter, som Venturia inequalis på epler; Monilinia-arter på frukter; Penicillium-arter på sitrus og epler.

Generelt sett er vektforholdet mellom komponent (A) og komponent (B) fra 2000:1 til 1:1000. Et ikke begrensende eksempel på slike vektforhold er forbindelse med formel 1:forbindelse med formel B-2 er 10:1. Vektforholdet mellom komponent (A) og komponent (B) er fortrinnsvis fra 100:1 til 1:100; mer foretrukket fra 20:1 til 1:50.

Det er overraskende blitt funnet at visse vektforhold mellom komponent (A) og komponent (B) kan skape synergistisk aktivitet. Følgelig er et ytterligere aspekt av oppfinnelsen sammensetninger hvor komponent (A) og komponent (B) er til stede i sammensetningen i mengder som gir en synergistisk effekt. Denne synergistiske aktiviteten fremgår fra de faktum at den soppdrepende aktiviteten av sammensetningen som omfatter komponent (A) og komponent (B) er større enn summen av de soppdrepende aktivitetene av komponent (A) og komponent (B). Denne synergistiske aktiviteten øker virkningsomfanget av komponent (A) og komponent (B) på to måter. For det første senkes påføringsratene til komponent (A) og komponent (B) samtidig som effekten forblir like bra, noe som betyr at virkestoffblandingen fortsatt oppnår en stor grad av plantepatogenkontroll selv når de to individuelle komponenter er blitt helt ineffektive i et såpass lavt påføringsrateområde. For det andre er det en vesentlig økning av det spekteret av plantepatogener som kan bekjempes.

En synergistisk effekt foreligger når virkningen av en aktiv bestanddelskombinasjon er større enn summen av virkningene til de individuelle komponenter. Virkningen E som kan forventes for en gitt kombinasjon av aktive bestanddeler følger den såkalte COLBY-formel og kan beregnes som følger (COLBY, S.R. "Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide combination". Weeds, vol. 15, sidene 20-22; 1967): ppm = milligram av aktiv bestanddel (= a.i. - "active ingredient") per liter av sprøyteblanding

$$X = \% \text{ virkning av aktiv bestanddel A ved bruk av } p \text{ ppm av aktiv bestanddel}$$

$$Y = \% \text{ virkning av aktiv bestanddel B ved bruk av } q \text{ ppm av aktiv bestanddel}$$

Ifølge COLBY er forventet (additiv) virkning av de aktive bestanddelene A + B ved bruk av p+q ppm av aktiv bestanddel



$$E = X + Y - \frac{X \cdot Y}{100}$$

Hvis den virkelig observerte virkningen (O) er større enn den forventede virkningen (E), så er virkningen av kombinasjonen superadditiv, dvs. det er en synergistisk effekt. I matematiske uttrykk tilsvarer synergisme en positiv verdi for forskjellen på (O-E). I det tilfelle hvor en helt komplementær addisjon av aktiviteter (forventet virkning) er den nevnte forskjellen (O-E) null. En negativ verdi på den nevnte forskjellen (O-E) anviser et virkningstap i forhold til den forventede virkningen.

Foruten den faktiske synergistiske virkningen med hensyn til soppdrepende aktivitet kan imidlertid sammensetningene ifølge oppfinnelsen også ha ytterligere overraskende fordelaktige egenskaper. Eksempler på slike fordelaktige egenskaper som kan nevnes er: mer fordelaktig nedbrytbarhet; forbedret toksikologisk og/eller økotoksikologisk atferd; eller forbedrete egenskaper av nytteplantene som inkluderer: oppkomst, avlingsresultat, mer utviklet rotsystem, økt busking, økt plantehøyde, større blad, færre døde grunnblad, sterkere skudd, grønnere bladfarge, mindre gjødselbehov, færre frø nødvendig, mer produktive skudd, tidligere blomstring, tidlig kornmodning, mindre aks- og stråknakk (legde), økt skuddvekst, økt spirekraft, og tidlig spiring.

Enkelte sammensetninger ifølge oppfinnelsen har en systemisk virkning og kan brukes som soppdrepende midler for blad-, jord- og frøbehandling.

Med sammensetningene ifølge oppfinnelsen er det mulig å undertrykke eller ødelegge de plantepatogene mikroorganismer som forekommer i planter eller i plantedeler (frukt, blomster, blad, stilker, rotknoller, røtter) i forskjellige nytteplanter, samtidig som plantedelene som vokser senere også er beskyttet mot angrep av plantepatogene mikroorganismer.

Sammensetningene ifølge oppfinnelsen kan påføres de plantepatogene mikroorganismer, nytteplantene, voksestedet til disse, formeringsmateriale til disse, lagringsvarer eller tekniske materialer truet av mikroorganismeangrep.

Sammensetningene ifølge oppfinnelsen kan påføres før eller etter infeksjon av mikroorganismene på nytteplantene, formeringsmateriale av disse, lagringsvarer eller tekniske materialer

Mengden av en sammensetning ifølge oppfinnelsen som skal påføres vil være avhengig av forskjellige faktorer, som hvilke forbindelser som benyttes;

gjenstanden for behandlingen, som for eksempel planter, jord eller frø;  
 behandlingstypen, som for eksempel sprøyting, påstrøing eller frøbeising; hensikten  
 med behandlingen, som for eksempel forebyggende eller terapeutisk; sopptypene  
 som skal bekjempes eller påføringstid.

- 5 Når den er påført nytteplantene blir komponent (A) typisk påført ved en rate på 5  
 til 2000 g a.i./ha, særlig 10 til 1000 g a.i./ha, f. eks. 50, 75, 100 eller 200 g a.i./ha  
 typisk i forbindelse med 1 til 5000 g a.i./ha, særlig 2 til 2000 g a.i./ha, f. eks. 100,  
 250, 500, 800, 1000, 1500 g a.i./ha av komponent (B).

- I jordbrukspraksis er sammensetningenes påføringsrate ifølge oppfinnelsen  
 10 avhengig av hva slags effekt som ønskes, og varierer typisk fra 20 til 4000 g av  
 total sammensetning per hektar.

- Når sammensetningene ifølge oppfinnelsen brukes for å behandle frø, er det  
 generelt tilstrekkelig med rater på 0,001 til 50 g for en forbindelse av komponent  
 (A) per kg frø, fortrinnsvis fra 0,01 til 10 g per kg frø, og 0,001 til 50 g for en  
 15 forbindelse av komponent (B) per kg frø, fortrinnsvis fra 0,01 til 10 g per kg frø.

- Sammensetningen ifølge oppfinnelsen kan benyttes i enhver tradisjonell form, for  
 eksempel i form av en dobbeltpakning, et pulver for tørr frøbehandling (DS = dry  
 seed treatment), en emulsjon for frøbehandling (ES = emulsion for seed  
 treatment), et flytende konsentrat for frøbehandling (FS = flowable concentrate for  
 20 seed treatment), en løsning for frøbehandling (LS), et vann-dispergerbart pulver for  
 frøbehandling (WS = water-dispersible powder for seed treatment), en  
 kapsulsuspensjon for frøbehandling (CF = capsule suspension for seed treatment),  
 en gel for frøbehandling (GF = gel for seed treatment), et emulsjonskonsentrat (EC  
 = emulsion concentrate), et suspensjonskonsentrat (SC = suspension concentrate),  
 25 en suspo-emulsjon (SE = suspo-emulsion), en kapsulsuspensjon (CS = capsule  
 suspension), en vann-dispergerbar granul (WG = water-dispersible granule), en  
 emulgerbar granul (EG = emulsifiable granule) en emulsjon, vann-i-olje (EO =  
 emulsion, water in oil), en emulsjon, olje-i-vann (EW = emulsion, oil in water), en  
 mikroemulsjon (ME = microemulsion), en oljedispersjon (OD = oil dispersion), et  
 30 flytende stoff blandbart med olje (OF = oil miscible flowable), en væske blandbar  
 med olje (OL = oil miscible liquid), et oppløsbart konsentrat (SL = soluble  
 concentrate), en suspensjon med ultra-lavt volum (SU = ultra-low volume  
 suspension), en væske med ultra-lavt volum (UL = ultra-low volume liquid), et  
 teknisk konsentrat (TK), et dispergerbart konsentrat (DC = dispersible

concentrate), et fuktbart pulver (WP = wettable powder) eller enhver teknisk mulig formulering kombinert med jordbruksmessig akseptable adjuvanter.

Slike sammensetninger kan fremstilles på tradisjonell måte, for eksempel ved å blande de aktive bestanddeler med minst én egnet inert formuleringsadjuvant (for eksempel, fortynningsmidler, løsemidler, fyllstoff og eventuelt andre 5 formuleringsbestanddeler som overflateaktive stoffer, biocider, frostvæske, klebemidler, fortykkere og forbindelser som gir adjuvanteffekter). Tradisjonelle formuleringer med langsom frigivelse kan også benyttes hvor hensikten er langvarig virksomhet. Særlig formuleringer som skal påføres i sprøyteformer, som vann-dispergerbare konsentrater (for eksempel EC, SC, DC, OD, SE, EW, EO og lignende), 10 fuktbare pulvere og granuler kan inneholde overflateaktive stoffer som fuktemidler og dispergeringsmidler og andre forbindelser som gir adjuvanteffekter, for eksempel kondenseringsproduktet av formaldehyd med naftalensulfonat, et alkylarylsulfonat, et ligninsulfonat, et fettalkylsulfat, og etoksyliert alkylfenol og en 15 etoksyliert fettalkohol.

Sammensetningene ifølge oppfinnelsen kan også omfatte ytterligere pesticider, som for eksempel soppdrepende midler, insektdrepende midler eller ugressdreper.

En formulering for frøbeising påføres frøene på en i og for seg kjent måte ved å benytte sammensetningene ifølge oppfinnelsen og et fortynningsmiddel i egnet 20 formuleringsform for frøbeising, for eksempel som en vandig suspensjon eller i en tørr pulverform som har god vedheft til frøene. Slike formuleringer for frøbeising er kjent i teknikken. Formuleringer for frøbeising kan inneholde de enkelte aktive bestanddeler eller de kombinasjoner med aktive bestanddeler i kapslet form, f. eks, som kapsler eller mikrokapsler med langsom frigivelse.

25 Generelt sett inkluderer formuleringene fra 0,01 til 90 vekt-% av aktivt stoff, fra 0 til 20 vekt-% jordbruksmessige akseptabelt overflateaktivt stoff og 10 til 99,99 vekt-% av fast eller flytende inerte formuleringsstoffer og formuleringsadjuvant(er), hvor det aktive stoffet består av minst en forbindelse av komponent (A) sammen med en forbindelse av komponent (B), og eventuelt andre 30 aktive stoffer, særlig mikrobiocider eller konserveringsmidler eller lignende.

Konsentrerte former av sammensetninger inneholder generelt mellom ca. 2 og 80 vekt-%, fortrinnsvis mellom ca. 5 og 70 vekt-% av aktivt stoff. Påføringsformer av formulering kan for eksempel inneholde fra 0,01 til 20 vekt-%, fortrinnsvis fra 0,01 til 5 vekt-% av aktivt stoff. Mens kommersielt tilgjengelige produkter fortrinnsvis

blir formulert som konsentrater vil sluttbrukeren som regel benytte fortynnede formuleringer.

Fremgangsmåter ifølge oppfinnelsen tillater også god kontroll over skadelige sopper som ofte er funnet på soyaplantar. De viktigste sopp sykdommer i soyabønner er  
 5 Phakopsora pachyrhizi, Microsphaera diffusa, Cercospora kikuchi, Cercospora sojina, Septoria glycines og Colletotrichum truncatum, og noen av disse omfatter den såkalte "sen-sesongssykdomskompleks", og videre Rhizoctonia solani, Corynespora cassiicola, Sclerotinia sclerotiorum og Sclerosium rolfsii.

10 Som beskrevet ovenfor inkluderer uttrykkene "nytteplante" og "soyaplante" enhver soyaplante og enhver varietet, herunder transgene planter. Uttrykket "soyaplante" inkluderer spesielt glyfosat-tolerante soyaplantar.

Med "glyfosat-tolerante" menes at plantene for bruk i fremgangsmåtene er resistente til glyfosat-påføring eller tolerante i forhold til glyfosat. Glyfosat-tolerante planter er gjort tolerante i forhold til glyfosat ved tradisjonell avling eller  
 15 ved å ha en transgen hendelse som gir glyfosat-resistens. Noen eksempler på slike foretrukne transgene planter med transgene hendelser som gir glyfosat-resistens er beskrevet i US patent nr. 5 914 451; 5 866 775; 5 804 425; 5 776 760; 5 633 435; 5 627 061; 5 463 175; 5 312 910; 5 310 667; 5 188 642; 5 145 783; 4 971 908 og  
 20 4 940 835. Det forestilles også bruken av "stabledede" transgene hendelser i planten.

Stabledede transgene hendelser, herunder ytterligere ugressmiddel-resistente trekk som resistens mot HPPD-hemmere, sulfonylkarbamider, glufosinat og bromoksynil er meget brukt og beskrevet i lett tilgjengelige hjelpeskilder. De stabledede transgene hendelser kan også rettes mot andre pesticid-resistente trekk, slik som resistens  
 25 mot insekticid, nematocid, fungicid osv., som kan fremstilles ved tradisjonell avling eller ved å introdusere en transgen hendelse. Typer av transgene glyfosat-tolerante avlingsplanter som forestilles brukt i fremgangsmåtene ifølge den foreliggende oppfinnelse inkluderer for eksempel Roundup Ready® soyabønner 40-3-2.

30 En "transgen plante" viser til en plante som inneholder genmateriale som ikke finnes (dvs. eksogen) i en vill-type plante av samme art, varietet eller kultivar. Genmaterialet kan inkludere en transgen, en innføringsmutagene hendelse (slik som ved transposon eller T-DNA innføringsmutagenese), en aktivator-merkesekevens, en mutert sekvens, en homolog rekombineringshendelse eller en  
 35 sekvens modifisert ved kìmæreplastik. Typisk er det fremmede genmateriale innført

i planten ved menneskelig manipulasjon, men enhver metode kan brukes som en fagmann vil forstå. En transgen plante kan inneholde en ekspresjonsvektor eller kassett. Ekspresjonskassetten omfatter typisk en polypeptidkodende sekvens operativt forbundet (dvs. under regulerende kontroll av) med passende indiserbare eller konstituerende regulerende sekvenser som muliggjør ekspresjonen av polypeptidet. Ekspresjonskassetten kan innføres i en plante ved transformering eller ved avling etter transformering av en morplante. Som beskrevet tidligere, viser en plante til hele planten, herunder frøplanter og modne planter, samt til en plantedel, slik som frø, frukt, blad eller rot, plantevev, planteceller eller ethvert annet plantemateriale, for eksempel forplantningsmateriale, samt avkom derav, og til *in vitro* systemer som hermer etter biokjemiske eller cellekomponenter eller prosesser i en celle.

Eksemplene som følger tjener til å illustrere oppfinnelsen, "aktiv bestanddel" betegner en blanding av komponent (A) og komponent (B) i et spesielt blandingsforhold.

#### **Formuleringseksempler**

<u>Fuktbare pulvere</u>	a)	b)
aktiv bestanddel [A]: B) = 1:3(a), 1:1(b)]	25 %	75 %
natriumlignosulfonat	5 %	-
natriumlaurylsulfat	3 %	5 %
natriumdiisobutylnaftalensulfonat	-	10 %
(7-8 mol av etylenoksid)		
høydispersert kiselsyre	5 %	10 %
kaolin	62 %	-

Den aktive bestanddel blandes grundig med de andre formuleringskomponenter og blandingen males grundig i en egnet kvern, og resulterer i fuktbare pulvere som kan fortynnes med vann slik at man får suspensjoner av den ønskede konsentrasjonen.

<u>Pulvere for tørr frøbehandling</u>	a)	b)
aktiv bestanddel [A] : B) = 1:3(a), 1:1(b)]	25 %	75 %
lett mineralolje	5 %	5 %
høydispersert kiselsyre	5 %	-
kaolin	65 %	-

<u>Pulvere for tørr frøbehandling</u>	a)	b)
talkum	-	20

Den aktive bestanddel blandes grundig med de andre formuleringskomponenter og blandingen males grundig i en egnet kvern, og resulterer i pulvere som kan brukes direkte for frøbehandling.

5

#### Emulgerbart konsentrat

aktiv bestanddel (A): B)=1:6)	10 %
oktylfenolpolyetylenglykoleter (4-5 mol av etylenoksid)	3 %
kalsiumdodecylbensulfonat	3 %
ricinusolje-polyglykoleter (35 mol av etylenoksid)	4 %
sykloheksanon	30 %
xylene-blanding	50 %

- 10 Emulsjoner av ethvert ønsket fortynningsnivå, som kan brukes ved plantebeskyttelse, kan oppnås fra dette konsentratet ved fortynning med vann.

<u>Strøbare pulvere</u>	a)	b)
aktiv bestanddel [A] : B) = 1:6(a), 1:10(b)]	5 %	6 %
talkum	95 %	-
kaolin	-	94 %

- 15 Bruksferdige strøpulvere oppnås ved å blande den aktive bestanddel med bærere og male blandingen i en egnet kvern. Slike pulvere kan også brukes for tørr beising av frø.

<u>Ekstruderte granuler</u>	% v/v
aktiv bestanddel (A) : B) = 2:1)	15 %
natriumlignosulfonat	2 %
natriumalkylnaftalensulfonat	1 %
kaolin	82 %

Den aktive bestanddel blandes og males med de andre formuleringskomponenter, og blandingen fuktes med vann. Blandingene ekstruderes og tørkes deretter i en luftstrøm.

5 Suspensjonskonsentrat

aktiv bestanddel (A) : B) = 1:8)	40 %
propylenglykol	10 %
nonylfenol-polyetylen glykoleter (15 mol etylenoksid)	6 %
natriumlignosulfonat	10 %
karboksymetylcellulose	1 %
silikonolje (i form av en 75 % emulsjon i vann)	1 %
vann	32 %

Den finfordelte aktive bestanddel blandes intensivt med de andre formuleringskomponenter, og resulterer i et suspensjonskonsentrat som kan fortynnes med vann ved enhver ønsket rate. Ved bruk av slike oppblandinger kan så vel levende planter som planteformeringsmateriale behandles og beskyttes mot infeksjon av mikroorganismer, ved sprøyting, påhelling eller neddypping.

Flytende konsentrat for frøbehandling

aktiv bestanddel (A) : B) = 1:8)	40 %
propylenglykol	5 %
kopolymer butanol PO/EO	2 %
tristyrenfenoletoksydat (med 10-20 mol EO)	2 %
1,2-benzisotiazolin-3-one	0,5 %
kalsiumsalt med monoazo-pigment	5 %
silikonolje (i form av en 75 % emulsjon i vann)	0,2 %
vann	45.3 %

15 Den finfordelte aktive bestanddel blandes intensivt med de andre formuleringskomponenter, og resulterer i et suspensjonskonsentrat som kan fortynnes videre i vann som skal påføres frøene. Ved bruk av slike oppblandinger kan formeringsmateriale behandles og beskyttes mot infeksjon av mikroorganismer, ved sprøyting, påhelling eller neddypping.

Biologiske eksempler

Eksempel B1: Soppdrepende virkning mot *Botrytis cinerea* (gråskimmel)

- Konidier av soppen fra kryogenisk lagring blandes direkte inn i næringsbuljong (PDB potetdekstrose-buljong). Etter å ha plassert en (DMSO) løsning av
- 5 forsøksforbindelser i en mikrotiterplate (96-brønnformat) tilsettes næringsbuljongen som inneholder soppsporene. Forsøksplatene inkuberes ved 24°C og veksthemmingen vurderes etter 4 dager. Den forventede soppdrepende virkning beregnes i henhold til Colby-metoden. Resultatene er oppgitt i tabellene B2:

10 Tabellene B1: Soppdrepende virkning mot *Botrytis cinerea*15 Tabell B1.1:

Forbindelse A-1.1	Fludioxonil		
ppm	ppm	% aktivitet	
0,2500		50	
0,1250		20	
0,0625		20	
0,0313		0	
0,0156		0	
	0,1250	90	
	0,0625	20	
	0,0313	0	forventet virkning (Colby)
0,2500	0,0625	100	60
0,1250	0,0625	100	36
0,1250	0,0313	50	20
0,0625	0,0625	90	36
0,0625	0,0313	50	20
0,0313	0,1250	100	90
0,0313	0,0625	90	20
0,0156	0,0625	70	20

Tabell B1.2:

Forbindelse A-1.2	Fludioxonil		
ppm	ppm	% aktivitet	
0,2500		20	



Forbindelse A-1.2	Fludioxonil		
ppm	ppm	% aktivitet	
0,1250		20	
0,0313		0	
	0,0625	20	forventet virkning (Colby)
0,2500	0,0625	50	36
0,1250	0,0625	50	36
0,0313	0,0625	50	20

Eksempel B2; Soppdrepende virkning mot *Septoria tritici* (hvetebldprikk):

- 5 Konidier av soppen fra kryogenisk lagring blandes direkte inn i næringsbuljong (PDB potetdekkstrose-buljong). Etter å ha plassert en (DMSO) løsning av forsøksforbindelser i en mikrotiterplate (96-brønnformat) tilsettes næringsbuljongen som inneholder soppsporene. Forsøksplatene inkuberes ved 24°C og veksthemmingen vurderes etter 4 dager. Den forventede soppdrepende virkning
- 10 beregnes i henhold til Colby-metoden. Resultatene er oppgitt i tabellene B2:

Tabellene B2: Soppdrepende virkning mot *Septoria tritici*:

Tabell B2.1

Forbindelse A-1.1	Fludioxonil		
ppm	ppm	% aktivitet	
0,5000		90	
0,2500		70	
	0,1250	0	
	0,0625	0	forventet virkning (Colby)
0,5000	0,1250	100	90
0,5000	0,1250	90	70
0,2500	0,0625	90	70

15

Eksempel B3; Fungicidvirkning mot *Alternaria solani* (tørrflekksyke, tomat/potet):

Konidier av soppen fra kryogenisk lagring blandes direkte inn i næringsbuljong (PDB potetdekkstrose-buljong). Etter å ha plassert en (DMSO) løsning av

forsøksforbindelser i en mikrotiterplate (96-brønnformat) tilsettes næringsbuljongen som inneholder soppsporene. Forsøksplatene inkuberes ved 24°C og veksthemmingen vurderes etter 3 dager. Den forventede soppdrepende virkning beregnes i henhold til Colby-metoden. Resultatene er oppgitt i tabellene B3:

5

Tabellene B3: Soppdrepende virkning mot *Alternaria solani*:

Tabell B3.1

Forbindelse A-1.1	Fludioxonil		
ppm	ppm	% aktivitet	
0,2500		50	
0,1250		50	
0,0625		50	
0,0313		20	
0,0156		20	
	0,2500	50	
	0,1250	50	
	0,0625	20	
	0,0313	0	
	0,0156	0	
	0,0078	0	forventet virkning (Colby)
0,2500	0,1250	90	75
0,2500	0,0625	70	60
0,1250	0,2500	90	75
0,1250	0,0625	70	60
0,1250	0,0313	70	50
0,0625	0,0625	70	60
0,0313	0,1250	70	60
0,0313	0,0625	70	36
0,0313	0,0313	50	20
0,0313	0,0156	50	20
0,0313	0,0078	50	20
0,0156	0,0625	50	36

10 Tabell B3.2:

Forbindelse A-1.2	Fludioxonil		
-------------------	-------------	--	--

ppm	ppm	% aktivitet	
0,5000		50	
0,2500		50	
0,1250		20	
0,0625		20	
0,0313		0	
	0,5000	70	
	0,2500	50	
	0,1250	20	forventet virkning (Colby)
0,5000	0,2500	90	75
0,5000	0,1250	70	60
0,2500	0,2500	90	75
0,2500	0,1250	70	60
0,1250	0,5000	90	76
0,1250	0,2500	90	60
0,1250	0,1250	50	36
0,0625	0,2500	70	60
0,0625	0,1250	50	36
0,0313	0,1250	50	20

Eksempel B4: Soppdrepende virking mot *Pseudocercospora herpotrichoide* (syn *Taperis yallundae*), stråknækker på kornsorter:

- 5 Konidier av soppen fra kryogenisk lagring blandes direkte inn i næringsbuljong (PDB potetdekstrose-buljong). Etter å ha plassert en (DMSO) løsning av forsøksforbindelser i en mikrotiterplate (96-brønnformat) tilsettes næringsbuljongen som inneholder soppsporene. Forsøksplatene inkuberes ved 24°C og veksthemmingen vurderes etter 4 dager. Den forventede soppdrepende virkning beregnes i henhold til Colby-metoden. Resultatene er oppgitt i tabellene B4:

10

Tabellene B4: Soppdrepende virking mot *Pseudocercospora herpotrichoide*

Tabell B4.1

Forbindelse A-1.1	Fludioxonil		
Ppm	ppm	% aktivitet	
0,0625		70	
0,0313		20	

Forbindelse A-1.1	Fludioxonil		
Ppm	ppm	% aktivitet	
	0,2500	20	
	0,0156	0	
	0,0078	0	forventet virkning (Colby)
0,0625	0,2500	90	76
0,0625	0,0156	90	70
0,0313	0,0156	50	20
0,0313	0,0078	50	20

Tabell B4.2:

Forbindelse A-1.2	Fludioxonil		
ppm	ppm	% aktivitet	
0,5000		70	
0,2500		20	
	2,0000	20	
	1,0000	20	
	0,5000	20	
	0,2500	20	forventet virkning (Colby)
0,5000	2,0000	100	76
0,5000	1,0000	100	76
0,5000	0,5000	90	76
0,2500	1,0000	70	36
0,2500	0,5000	70	36
0,2500	0,2500	50	36

5 Eksempel B5: Soppdrepende virkning mot *Pyrenophora teres* (byggbrunflekk):

Konidier av soppen fra kryogenisk lagring innblandes direkte inn i næringsbuljong (PDB potetdekstrose-buljong). Etter å ha plassert en (DMSO) løsning av forsøksforbindelser i en mikrotiterplate (96-brønnformat) tilsettes næringsbuljongen som inneholder soppsporene. Forsøksplatene inkuberes ved 24°C og veksthemmingen vurderes etter 4 dager. Den forventede soppdrepende virkning beregnes i henhold til Colby-metoden. Resultatene er oppgitt i tabellene B5:

Tabellene B5: Soppdrepende virkning mot *Pyrenophora teres*:

15 Tabell B5.1:

Forbindelse A-1.1	Fludioxonil		
ppm	ppm	% aktivitet	
0,5000		50	
0,2500		50	
0,1250		20	
0,0625		20	
0,0313		20	
0,0156		0	
	0,1250	70	
	0,0625	20	forventet virkning (Colby)
0,5000	0,1250	100	85
0,2500	0,1250	100	85
0,1250	0,1250	100	76
0,1250	0,0625	50	36
0,0625	0,1250	90	76
0,0313	0,1250	90	76
0,0313	0,0625	20	36
0,0156	0,0625	90	20

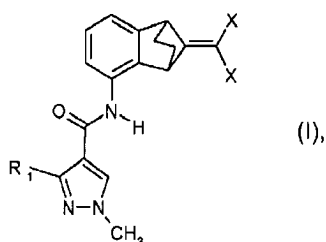
Tabell B5.2:

Forbindelse A-1.2	Fludioxonil		
ppm	ppm	% aktivitet	
0,2500		20	
0,1250		20	
0,0625		20	
0,0313		0	
	0,1250	70	forventet virkning (Colby)
0,2500	0,1250	90	76
0,1250	0,1250	90	76
0,0625	0,1250	90	76
0,0313	0,1250	100	70

P a t e n t k r a v

1. En sammensetning som er egnet for bekjempelse av sykdommer forårsaket av plantepatogener som omfatter (A) en forbindelse med formel I

5



hvor  $R_1$  er difluormetyl eller trifluormetyl og X er klor, fluor eller brom; og (B) forbindelsen fludioxonil.

10 2. En sammensetning ifølge krav 1, hvor komponent (A) er en forbindelse med formel (I), hvor  $R_1$  er difluormetyl.

3. En sammensetning ifølge krav 1, hvor komponent (A) er en forbindelse med formel (I), hvor  $R_1$  er difluormetyl og X er klor.

15

4. En sammensetning ifølge krav 1, hvor komponent (A) er en forbindelse med formel (I), hvor  $R_1$  er difluormetyl og X er fluor.

20 5. En sammensetning ifølge krav 1, hvor komponent (A) er en forbindelse med formel (I), hvor  $R_1$  er difluormetyl og X er brom.

6. En sammensetning ifølge krav 1, som omfatter som komponent (A) en forbindelse valgt fra 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre (9-diklormetyliden-benzonorboren-5-yl)amid og 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre (9-difluormetyliden-benzonorboren-5-yl)amid, og som komponent (B) fludioxonil.

7. En sammensetning ifølge krav 1, som omfatter som komponent (A) forbindelse 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre (9-diklormetyliden-benzonorboren-5-yl)amid, og som komponent (B) fludioxonil.

30

8. En sammensetning ifølge krav 1, som omfatter som komponent (A) forbindelse 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksytsyre (9-difluormetylidbenzonorbornen-5-yl)amid, og som komponent (B) fludioxonil.
- 5 9. En sammensetning ifølge krav 1 hvor vektforholdet mellom (A) og (B) er fra 2000:1 til 1:1000.
- 10 10. En fremgangsmåte for bekjempelse av sykdommer på nytteplanter eller på formeringsmateriale av disse forårsaket av plantepatogener, som omfatter å påføre nytteplantene, deres voksested eller deres formeringsmateriale en sammensetning ifølge krav 1.
- 15 11. En fremgangsmåte for bekjempelse av sykdommer på soyaplanter forårsaket av plantepatogener som omfatter å påføre soyaplantene eller deres voksested en sammensetning ifølge krav 1.
12. En fremgangsmåte ifølge krav 12 hvor plantepatogenet er *Phakopsora pachyrhizi*.