



(12) **Øversettelse av  
europeisk patentskrift**

(11) **NO/EP 2196089 B1**

**NORGE**

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

**Patentstyret**

---

- (21) Oversettelse publisert 2011.07.18
- (80) Dato for Den Europeiske Patentmyndighets publisering av det meddelte patentet: 2011.03.16
- (86) Europeisk søknadsnr: 10157580.1
- (86) Europeisk innleveringsdag 2008.04.23
- (87) Den europeiske søknadens Publiseringsdato 2010.06.16
- (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, Sveits  
Walter, Harald, Syngenta Crop Protection Mnchwilen AG, Schaffhauserstrasse4332, Stein, Sveits  
Haas, Ulrich Johannes, Syngenta Crop Protection Mnchwilen AG, Schaffhauserstrasse4332, Stein, Sveits
- (74) Fullmektig Zacco Norway AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

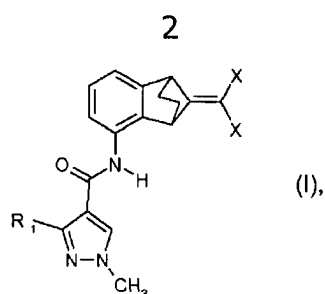
- 
- (54) Benevnelse **Fungicide sammensetninger**
- (56) Anfrte publikasjoner WO-A-2004/035589 B1, WO-A1-2007/048556 B1, WO-A-2006/037632 B1

## Fungicide sammensetninger

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.

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)



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

10 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 følge  
denne fremgangsmåten når de anvendes alene.

15 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 voksested eller deres  
formeringsmateriale, en sammensetning ifølge oppfinnelsen.  
20 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  
25 oppfinnelsen.

Forbindelsene med formel I forekommer i to forskjellige  
stereoisomerer som er beskrevet som de enkelte enantiomerer med  
formlene  $I_I$  og  $I_{II}$ :

30



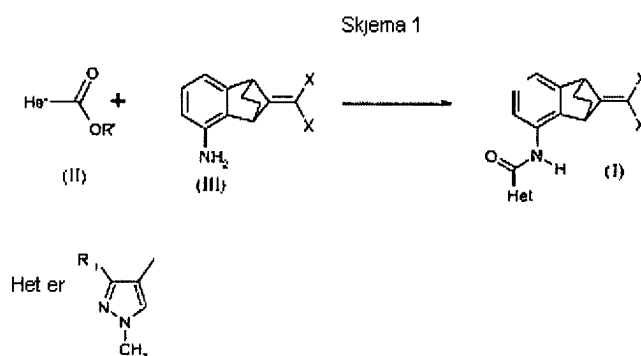
Særlig foretrukne forbindelser ifølge oppfinnelsen omfatter som komponent (A) en forbindelse valgt fra 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre (9-diklormetyliden-benzonorbornen-5-yl)amid (forbindelse A-1.1) og 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre (9-difluormetyliden-benzonorbornen-5-yl)amid (forbindelse A-1.2) og som komponent (B) klortalonil.

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) klortalonil.

Ytterligere særlig foretrukne forbindelser ifølge oppfinnelsen omfatter som 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) klortalonil.

15

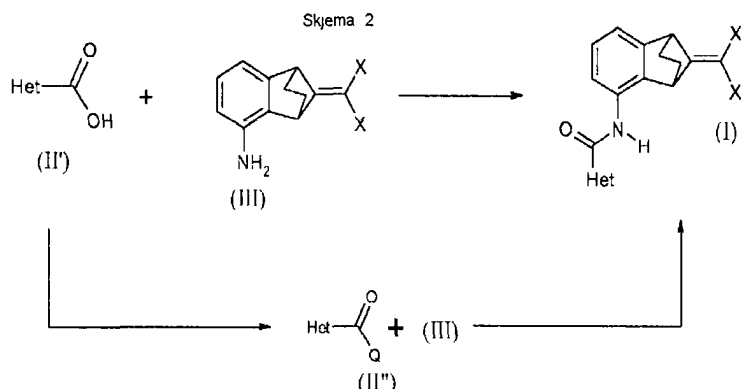
Forbindelsen med formel (I) kan fremstilles som beskrevet nedenfor med henvisning til reaksjonsskjemaene 1 til 3.



20 Som det fremgår fra skjema 1 kan en forbindelse med formel (I), hvor  $R_1$  og X er som definert ovenfor, syntetiseres ved å reagere en forbindelse med formel (II), hvor  $R_1$  er som definert ovenfor og  $R'$  er  $C_{1-5}$  alkyl, med en anilin-forbindelse med formel (III), hvor X er som definert ovenfor, i nærvær av  $\text{NaN}(\text{TMS})_2$  ved  $-10^\circ\text{C}$  til

25 omgivelsestemperatur, fortrinnsvis i tørr THF, som beskrevet av J.Wang et al, *Synlett*, 2001, 1485.

5



Alternativt, som det fremgår fra skjema 2, kan en forbindelse med formel (I), hvor Het er som definert i skjema 1, R<sub>1</sub> og X er som

5 definert ovenfor, fremstilles ved å reagere en forbindelse med formel (II'), hvor Het er som definert ovenfor, med en anilin-forbindelse med formel (III), hvor X er som definert ovenfor, i nærvær av et aktiverende middel, som BOP-Cl (bis-(2-okso-3-oxsalolidinyl)-fosfinsyre), og to ekvivalenter av en base, som trietylamin, i et

10 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 Het er som definert ovenfor og Q er klor, fluor eller brom, med en anilin-forbindelse med formel (III), hvor X er som

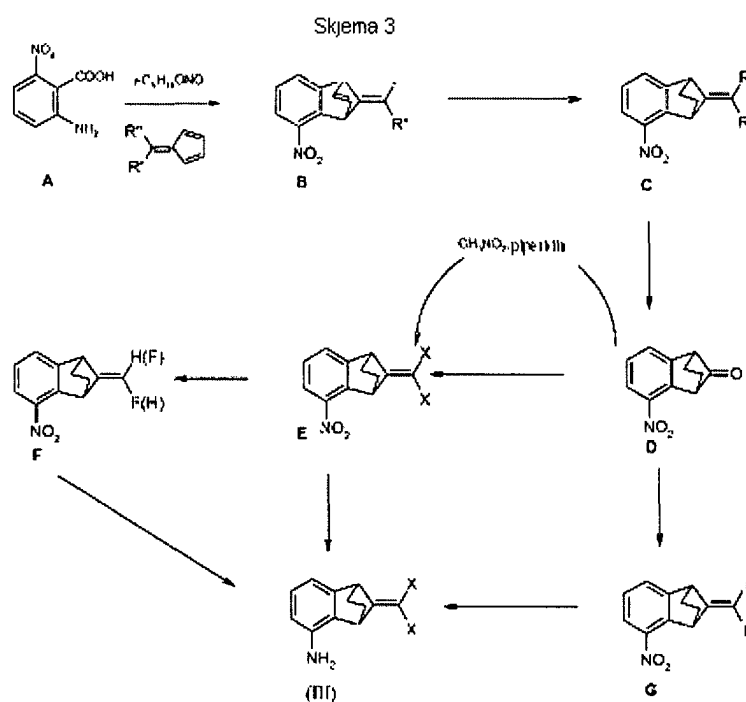
15 definert ovenfor, i nærvær av én ekvivalent av en base, som trietylamin eller natrium- eller kaliumkarbonat eller -bikarbonat, i et løsemiddel, som diklormetan, etylacetat eller N,N-dimetylformamid, fortrinnsvis ved -10°C til 30°C. Forbindelsen med formel (II'') oppnås fra en forbindelse med formel (II') ved behandling med et

20 halogenerende middel som tionylklorid, tionylbromid, oksalyklorid, fosgen, SF<sub>4</sub>/HF, DAST (dietylamino)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

25 fremstilles som 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.

6



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

De 9-dihalometylidene-5-nitro-benzonorboren-forbindelsene (E), hvor X er klor, brom eller fluor, kan oppnås ved *Wittig*-olefineringen av ketonene (D) med dihalometylidendifosforaner  $R'''_3P=C(R^4)R^5$  genererte *in situ*, hvor  $R'''$  er trifenyl,  $triC_{1-4}$  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.

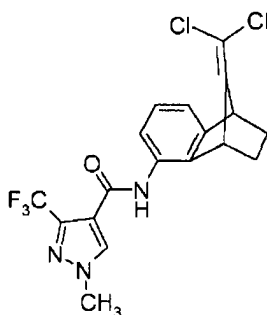
### **EKSEMPEL 1**

20

7

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

5

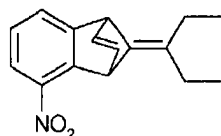


9-diklormetylen-5-amino-benzonorbornen (175 mg, 0,729 mmol, fremstilt som beskrevet i eksempel 6) i diklormetan (10 ml) ble  
 10 reagert med 1-metyl-3-trifluormetyl-1H-pyrazol-karboksylysyre (170 mg, 0,874 mmol, 1,2 ekv.) i nærvær av bis-(2-okso-3-oksazolidiyl)-fosfinsyre-klorid (278 mg, 1,09 mmol, 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  
 15 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-diklormetyliden-benzonorbornen-5-yl)amid (forbindelse A-1.4, smp. 179-181°C) ble oppnådd.

20

### **EKSEMPEL 2**

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



25

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%

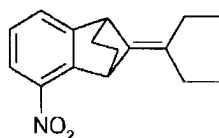


8

renhet, 2,5 ekv.) oppløst i 25 ml av dimetoskyetan 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).

### **EKSEMPEL 3**

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

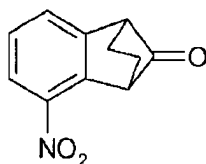


15 9-(3-pentyliden)-5-nitro-benzonorbornadien (7,97g fremstilt som beskrevet i eksempel 2) i THF (70 ml) ble hydrogenert ved 20°C i nærvær av Rh(PPh<sub>3</sub>)<sub>3</sub>Cl (*Wilkinsons* katalysator, 0,8 g). Reaksjonen opphørte etter opptak av én ekvivalent av hydrogen. Fordampning og filtrering av 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:



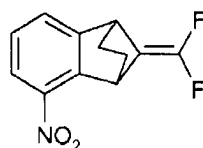
25

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. 30 15 minutter). Reaksjonsblandingen ble spylt med nitrogengass. Trifenylofosfin (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).

### **EKSEMPEL 5**

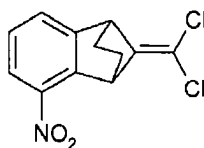
- 5 Dette eksemplet viser fremstillingen av 9-difluormetyliden-5-nitro-benzonorbornen:



- 10 Til en løsning av dibromdifluormetan (6,30 g, 30 mmol) ved 0°C i THF (50 ml) ble tris-(dimetyl-amino)-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
- 15 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:



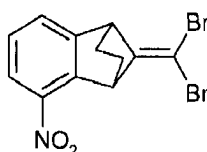
- 25 Tørt korbontetraklorid (5,9 g, 33 mmol) ble reagert med trifenyfosfin (14,46 g, 55,1 mmol) i diklormetan (30 ml) ved romtemperatur i 1 time. 9-okso-5-nitro-benzonorbornen (5,60 g, 27,56 mmol; fremstilt som beskrevet i eksempel 4) i diklormetan (10 ml) ble tilsatt dråpevis og omrørt i 20 timer ved romtemperatur. Etter vandig opparbeidelse
- 30 (isvann) og ekstrahering med diklormetan, ble råproduktet rensset på silikagel i etylacetat-heksan-(1:4) for å oppnå det ønskede 9-

10

diklormetyliden-5-nitro-benzonorbornen (1,83 g; smp. 136-137°C).  
En del av utgangsmaterialet (4,06 g) ble gjenvunnet.

### **EKSEMPEL 7**

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



10

- Karbondetribromid (4,66 ved 98 %, 13,8 mmol) ble reagert under omrøring med trifenyfosfin (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
- 15 eksempl 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).

20

### **Tabell 1**

- Tabell 1 viser smeltepunkt og NMR-data, alle med CDCl<sub>3</sub> som løsemiddel, med mindre annet er oppgitt, for forbindelser med formel (I). I tabellen er temperaturer oppgitt i grader Celsius, "NMR" betyr
- 25 nukleær magnetisk resonans spektrum og følgende forkortelser brukes:

smp. -	smeltepunkt	kp. =	kokepunkt
s =	enkelt	br =	bred
d =	dublett	dd =	dublett av dublettene
t =	triplett	q =	kvartett
m =	multipllett	ppm =	deler per million
THF =	tetrahydrofuran		

Forbindelse	smp. (°C)	<sup>1</sup> H-NMR protonskift δ (ppm) (CDCl <sub>3</sub> )
A-1.1	179-181	8,06 (s,1H), 7,69 (d overlappet av brd signal, utbyttbar med D <sub>2</sub> 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 D <sub>2</sub> 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] den er der beskrevet under oppslagsnummer (142).

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.

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*, *Plasmopara*).

Ifølge oppfinnelsen omfatter "nytteplanter" typisk følgende plantearter: vinstokker; kornsorter som hvete, bygg, rug eller havre; betesom sukkerroe eller bladete; 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 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; 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 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 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 av ugressmidler ved genteknologiske metoder inkluderer glyfosat- og glyfosinat-resistente maistyper som er tilgjengelige 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 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). 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.

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.

- 5 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, rotstokker og
- 10 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 omplanting ved en fullstendig eller delvis behandling ved neddypping. Fortrinnsvis forstås "planteformeringsmateriale" å betegne frø.

15

- 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
- 20 og deres bearbeidede former som har blitt hentet fra den 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,
- 25 finfordelt, oppmalt, presset eller ristet. Også omfattet av definisjonen av lagringsvarer er tømmer, uansett om det er i form av råttømmer, som konstruksjonstømmer, høyspenningmaster og barrierer, eller i form av ferdiglagde artikler som møbler eller gjenstander laget av tre. Lagringsvarer av animalsk opprinnelse er
- 30 hud, skinn, pels, hår og lignende. Sammensetningene ifølge den foreliggende oppfinnelse kan forhindre ugunstige påvirkninger som forråtnelse, misfarging eller mugg.

- Fortrinnsvis forstås "lagringsvarer" å betegne naturlige stoffer av
- 35 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.

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

10 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 15 ugunstige påvirkninger som forråtnelse, misfarging eller mugg.

20 Sammensetningene ifølge den foreliggende oppfinnelse er særlig effektive mot meldugg; rust; bladfleksykdommer; tørrfleksyke 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 gresstorv, grønnsaker, solsikke og raps; svartråte, rød rotråte, meldugg, gråskimmel og "deadarm"-syke i ranker; *Botrytis cinerea* i frukter; *Monlinia* spp. i frukter og *Penicillium* spp. i frukter. 25

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*, *Gäumannomyces graminis*, *Helminthosporium* spp., *Microdochium nivale*, *Phoma* spp., *Pyrenophora graminea*, *Pyricularia oryzae*, *Rhizoctonia solani*, *Rhizoctonia cerealis*, *Sclerotinia* spp., *Septoria* 35 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.

- Sammensetningene ifølge oppfinnelsen er dessuten særlig effektive
- 5 mot etterinnhøstingssykdommer som *Botrytis cinerea*, *Colletotrichum musae*, *Curvularia lunata*, *Fusarium semitectum*, *Geotrichum candidum*, *Monilinia fructicola*, *Monilinia fructigena*, *Monilinia laxa*, *Mucor piriformis*, *Penicilium italicum*, *Penicilium solitum*, *Penicillium digitatum* eller *Penicillium expansum* særlig mot patogene av frukter
- 10 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
- 20 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;
- 25 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 pachyrizi i soyabønner; Puccinia-arter i kornsorter, bredbladete avlinger og flerårige planter; som Puccinia recondita på hvete, Puccinia striiformis
- 30 på hvete og Puccinia recondita på bygg; Pseudocercospora-arter i kornsorter, som Pseudocercospora herpotrichoides i hvete; Phragmidium mucronatum i roser; Podosphaera-arter i frukter; Pyrenophora-arter i bygg, som Pyrenophora teres på bygg; Pyricularia oryzae i ris; Ramularia collo-cygni i bygg; Rhizoctonia-
- 35 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 glycinis på soyabønner; 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. –

- 5 "active ingredient") per liter av sprøyteblanding  
 X = % virkning av aktiv bestanddel A) ved bruk av p ppm av aktiv bestanddel Y = % virkning av aktiv bestanddel B) ved bruk av q ppm av aktiv bestanddel Ifølge COLBY er forventet (additiv) virkning av de aktive bestanddelene A) + B) ved bruk av  
 10 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 virkingen av kombinasjonen superadditiv, dvs. det er en synergistisk effekt. I matematiske  
 15 uttrykk tilsvarende 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.

- 20 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  
 25 og/eller økotoksikologisk atferd; eller forbedrede 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  
 30 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  
5 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  
10 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  
15 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  
20 bekjempes eller påføringstid.

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,  
25 1500 g a.i./ha av komponent (B).

I jordbrukspraksis er sammensetningenes påføringsrate ifølge oppfinnelsen 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,  
30 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 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

5 konsentrat for frøbehandling (FS = flowable concentrate for 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

10 for seed treatment), et emulsjonskonsentrat (EC = emulsion concentrate), et suspensjonskonsentrat (SC = suspension concentrate), 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 flytende stoff blandbart med olje (OF = oil miscible flowable), en væske blandbar med olje (OL = oil miscible liquid), et

20 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

25 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 formuleringsbestanddeler som

30 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

35 eksempel EC, SC, DC, OD, SE, EW, EO og lignende), 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 etoksyliert fettalkohol.

- 5 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  
10 fortynningsmiddel i egnet 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  
15 kapslet form, f. eks, som kapsler eller mikrokapsler med langsom frigivelse.

- 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  
20 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 aktive stoffer, særlig mikrobiocider eller konserveringsmidler eller lignende. Konsentrerte former av sammensetninger inneholder  
25 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  
30 regel benytte fortynnede formuleringer.

- Fremgangsmåter ifølge oppfinnelsen tillater også god kontroll over skadelige sopper som ofte er funnet på soyaplanter. De viktigste sopp sykdommer i soyabønner er *Phakopsora pachyrhizi*,  
Microsphaera diffusa, Cercospora kikuchi, Cercospora sojina, Septoria  
35 glycines og Colletotrichum truncatum, og noen av disse omfatter den

såkalte "sen-sesongssykdomskompleks", og videre *Rhizoctonia solani*, *Corynespora cassiicola*, *Sclerotinia sclerotiorum* og *Sclerosium rolfsii*.

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

Med "glyfosat-tolerante" menes at plantene for bruk i fremgangsmåtene er resistente til glyfosat-påføring eller tolerante i  
 10 forhold til glyfosat. Glyfosat-tolerante planter er gjort tolerante i forhold til glyfosat ved tradisjonell avling eller 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;  
 15 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 4 940 835. Det forestilles også bruken av "stabledede" transgene hendelser i planten.

Stablede transgene hendelser, herunder ytterligere ugressmiddel-resistente trekk som resistens mot HPPD-hemmere,  
 20 sulfonylkarbamider, glufosinat og bromoksynil er meget brukt og beskrevet i lett tilgjengelige hjelpekilder. De stablede transgene hendelser kan også rettes mot andre pesticid-resistente trekk, slik som resistens mot insekticid, nematicid, fungicid osv., som kan fremstilles ved tradisjonell avling eller ved å introdusere en transgen  
 25 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.

En "transgen plante" viser til en plante som inneholder genmateriale  
 30 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 sekvens  
 35 modifisert ved kimæreplasti. 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 kasset. Ekspresjonskassetten omfatter typisk en polypeptidkodende sekvens operativt forbundet
- 5 (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
- 10 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.
- 15 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)		
høydispergert kiselsyre	5 %	10 %
kaolin	62 %	-

20

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.

25

<u>Pulvere for tørr frøbehandling</u>	a)	b)
aktiv bestanddel [A] : B) = 1:3(a), 1:1(b)]	25 %	75 %



<u>Pulvere for tørr frøbehandling</u>	a)	b)
lett mineralolje	5 %	5 %
høydispergert kiselsyre	5 %	-
kaolin	65 %	-
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

5 frøbehandling.

#### Emulgerbart konsentrat

aktiv bestanddel (A): B)=1:6)	10 %
oktylfenolpolyetylen glykoleter (4-5 mol av etylenoksid)	3 %
kalsiumdodecylbenzensulfonat	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 fortykning 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.

20

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

25

<u>Ekstruderte granuler</u>	% v/v
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-polyetylenglykoleter (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 planteforneringsmateriale behandles og beskyttes mot infeksjon av mikroorganismer, ved sprøyting, påhelling eller neddypping.

#### 15 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 %

- 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
- 5 beskyttes mot infeksjon av mikroorganismer, ved sprøyting, påhelling eller neddypping.

### Biologiske eksempler

- 10 Eksempel B1; Soppdrepende virkning mot *Septoria tritici* (hvetebldprikk):

- 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-
- 15 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 B1:

20

### Tabellene B1: Soppdrepende virkning mot *Septoria tritici*:

Tabell B1.1

Forbindelse A-1.1	klortalonil		
ppm	ppm	% aktivitet	
0,5000		90	
0,2500		70	
0,1250		50	
	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
0,1250	0,1250	70	50

Eksempel B2: Soppdrepende virking mot *Pseudocercospora herpotrichoide* (syn *Taperis yallundae*), stråknækker på kornsorter:

- 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 B2:

Tabellene B2: Soppdrepende virking mot *Pseudocercospora herpotrichoide*

15 Tabell B2.1

Forbindelse A-1.1	klortalonil		
ppm	ppm	% aktivitet	
0,0313		20	
0,0156		20	
0,0078		0	
	0,0313	50	
	0,0156	0	forventet virkning (Colby)
0,0313	0,0313	70	60
0,0313	0,0156	50	20
0,0156	0,0313	70	60
0,0078	0,0313	70	50

Tabell B2.2:

Forbindelse A-1.2	klortalonil		
ppm	ppm	% aktivitet	
0,1250		0	
0,0625		0	
0,0313		0	

28

0,0156		0	
	0,1250	90	
	0,0313	50	forventet virkning (Colby)
0,1250	0,1250	100	90
0,1250	0,0313	90	50
0,0625	0,1250	100	90
0,0625	0,0313	70	50
0,0313	0,1250	100	90
0,0313	0,0313	70	50
0,0156	0,0313	70	50

Eksempel B3: Soppdrepende virkning mot *Pyrenophora teres* (byggbrunfleck):

- 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 B3:

Tabellene B3: Soppdrepende virkning mot *Pyrenophora teres*:

- 15 Tabell B3.1:

Forbindelse A-1.1	klortalonil		
ppm	ppm	% aktivitet	
2,0000		70	
1,0000		70	
0,5000		70	
0,2500		50	
0,1250		20	
	0,5000	20	forventet virkning (Colby)
2,0000	0,5000	100	76
1,0000	0,5000	100	76

29

Forbindelse A-1.1	klortalonil		
ppm	ppm	% aktivitet	
0,5000	0,5000	100	76
0,2500	0,5000	100	60
0,1250	0,5000	100	36

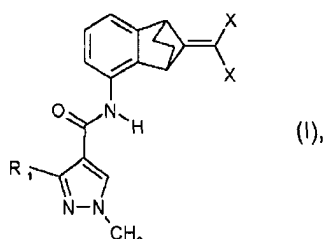
Tabell B3.2:

Forbindelse A-1.2	klortalonil		
ppm	ppm	% aktivitet	
2,0000		70	
1,0000		50	
0,5000		50	
0,2500		20	
0,1250		20	
	0,5000	20	
	0,2500	0	forventet virkning (Colby)
2,0000	0,5000	90	76
1,0000	0,5000	90	60
0,5000	0,5000	100	60
0,2500	0,5000	100	36
0,2500	0,2500	50	20
0,1250	0,5000	100	36

5

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



- hvor  $R_1$  er difluormetyl eller trifluormetyl og X er klor, fluor eller brom; og
- 10 (B) forbindelsen klortalonil.
2. En sammensetning ifølge krav 1, hvor komponent (A) er en forbindelse med formel (I), hvor  $R_1$  er difluormetyl.
- 15 3. En sammensetning ifølge krav 1, hvor komponent (A) er en forbindelse med formel (I), hvor  $R_1$  er difluormetyl og X er klor.
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) klortalonil.
- 25 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) klortalonil.
- 30

8. En sammensetning ifølge krav 1, som omfatter som komponent (A) forbindelse 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre (9-difluormetylidene-benzonorboren-5-yl)amid, og som komponent
- 5 (B) klortalonil.
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.
- 20 12. En fremgangsmåte ifølge krav 11 hvor plantepatogenet er *Phakopsora pachyrhizi*.