



(12) **Øversettelse av
europeisk patentskrift**

(11) **NO/EP 2201839 B1**

NORGE

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

Patentstyret

- (21) Oversettelse publisert 2011.11.07
- (80) Dato for Den Europeiske Patentmyndighets publisering av det meddelte patentet: 2011.08.24
- (86) Europeisk søknadsnr: 10157590.0
- (86) Europeisk innleveringsdag 2008.04.23
- (87) Den europeiske søknadens Publiseringsdato 2010.06.30
- (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 Munchwilen AG, Schaffhauserstrasse4332, Stein, Sveits
Haas, Ulrich Johannes, Syngenta Crop Protection Munchwilen AG, Schaffhauserstrasse4332, Stein, Sveits
- (74) Fullmektig Tandbergs Patentkontor AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

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

Fungicide sammensetninger

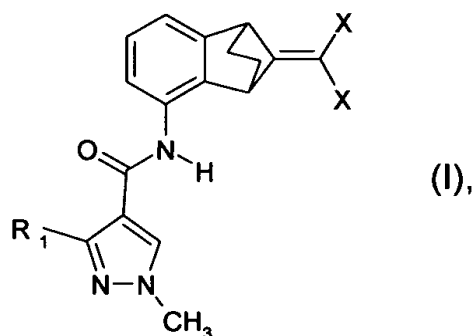
Foreliggende oppfinnelse vedrører nye fungicide sammensetninger egnet for kontroll av sykdommer forårsaket av fytopatogener, spesielt fytopatogene sopper, og en fremgangsmåte for å kontrollere sykdommer på nytteplanter, spesielt rustsykdommer på soyabønneplanter.

Det er kjent fra WO 04/35589 og WO 06/37632 at visse trisykliske aminderivater og blandinger omfattende nevnte aminderivater har biologisk aktivitet mot fytopatogene sopper. På den andre siden er forskjellige fungicide forbindelser fra forskjellige kjemiske klasser velkjente som plantefungicider for anvendelse i forskjellige avlinger av dyrkede planter. Imidlertid tilfredsstillende avlingstoleranse og aktivitet mot fytopatogene plantesopper ikke alltid behovene innen jordbruk i mange henseender og aspekter. For eksempel var det tidligere, i de viktigste områdene for dyrking av soyabønner, ikke kjent noen økonomisk signifikante fytopatogener. I den senere tid har det imidlertid vært en økning i alvorlige rustinfeksjoner i soyabønneavlinger i Sør-Amerika ved den skadelige soppen *Phakopsora pachyrhizi* som har resultert i betydelige utbyttestap. De fleste vanlige fungicider er uegnede for å kontrollere rust i soyabønner eller deres virkning mot *Phakopsora pachyrhizi* er utilfredsstillende.

På bakgrunn av de ovenfor nevnte behovene innen jordbruk for å øke avlingstoleransen og/eller øke aktiviteten mot fytopatogene sopper, så som *Phakopsora pachyrhizi*, foreslås det derfor, ifølge foreliggende oppfinnelse, en ny sammensetning som er egnet for å kontrollere sykdommer forårsaket av fytopatogener omfattende en sammensetning egnet for kontroll av sykdommer forårsaket av fytopatogener omfattende

(A) en forbindelse med formel I

30



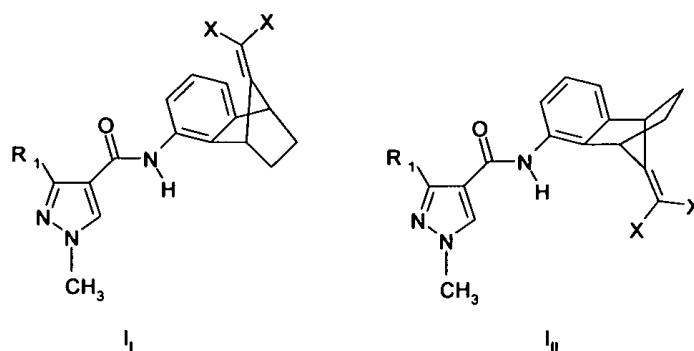
hvor R_1 er difluormetyl eller trifluormetyl og X er klor, fluor eller brom; og
 (B) fluopyram.

5

Det er funnet av anvendelsen av komponent (B) i kombinasjon med komponent (A) overraskende og vesentlig forbedrer effektiviteten av sistnevnte mot sopp, og vice versa. I tillegg er fremgangsmåten ifølge oppfinnelsen effektiv mot et bredere spekter av slike sopper som kan bekjempes med de aktive bestanddele-
 10 ne i henhold til denne fremgangsmåten, når de anvendes alene.

Et ytterligere trekk ved den foreliggende oppfinnelse er en fremgangsmåte for å kontrollere sykdommer på nytteplanter eller på formeringsmateriale derav forårsaket av fytopatogener, som omfatter å påføre på nytteplantene, på voksestedet
 15 for disse eller formeringsmateriale derav en sammensetning ifølge oppfinnelsen. Foretrukket er en fremgangsmåte som omfatter påføring på nytteplantene eller deres voksested av en sammensetning ifølge oppfinnelsen, mer foretrukket på nytteplantene. Ytterligere foretrukket er en fremgangsmåte som omfatter påføring på formeringsmaterialet for nytteplantene av en sammensetning ifølge opp-
 20 finnelsen.

Forbindelsene med formel I opptrer i to forskjellige stereoisomerer, som beskrives som de enkelte enantiomerene med formlene I_I og I_{II} :



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 formlene I_I og I_{II}.

En foretrukket utførelsesform av oppfinnelsen er representert ved de sammensetningene som omfatter som komponent (A) en forbindelse med formel (I) hvori R₁ er difluormetyl. Ytterligere foretrukne forbindelser med formel (I) er:

3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre(9-diklormetylyliden-benzonorbornen-5-yl)amid (forbindelse A-1.1); 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre(9-difluormetylyliden-benzonorbornen-5-yl)amid (forbindelse A-1.2); og 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre(9-dibrommetylyliden-benzonorbornen-5-yl)amid (forbindelse A-1.3).

Angivelsen av substituent X som klor, fluor eller brom betyr at begge substituentene X har samme betydning.

En foretrukket utførelsesform av oppfinnelsen er representert ved de sammensetningene som omfatter som komponent (A) en forbindelse med formel (I), hvori R₁ er trifluormetyl. Ytterligere foretrukne forbindelser med formel (I) er:

1-metyl-3-trifluormetyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre(9-diklormetylyliden-benzonorbornen-5-yl)amid (forbindelse A-1.4);

1-metyl-3-trifluormetyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre(9-difluormetylyliden-benzonorbornen-5-yl)amid (forbindelse A-1.5); og

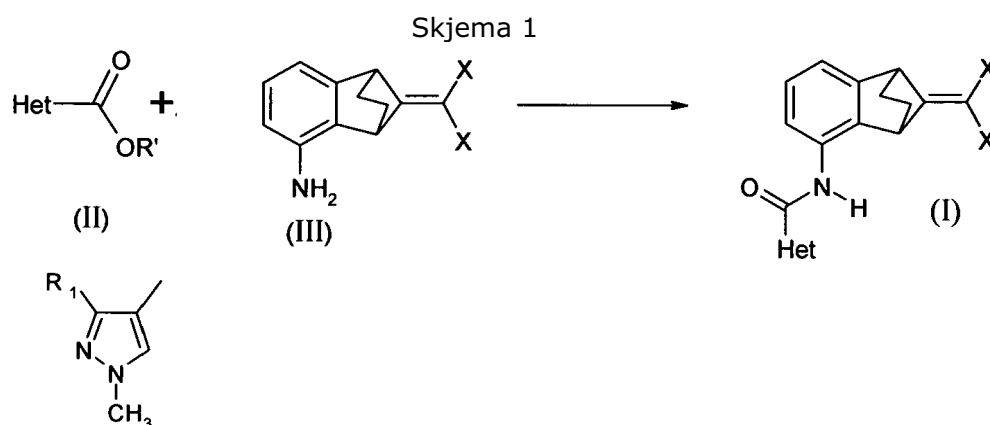
1-metyl-3-trifluormetyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre(9-dibrommetylyliden-benzonorbornen-5-yl)amid (forbindelse A-1.6).

Spesielt foretrukne sammensetninger ifølge oppfinnelsen omfatter som komponent (A) en forbindelse valgt fra 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre(9-diklormetylyliden-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) fluopyram.

- Ytterligere spesielt foretrukne sammensetninger 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) fluopyram.

Forbindelsene med formel (I) kan fremstilles som beskrevet nedenfor med henvisning til reaksjonsskjemaer 1 til 3.

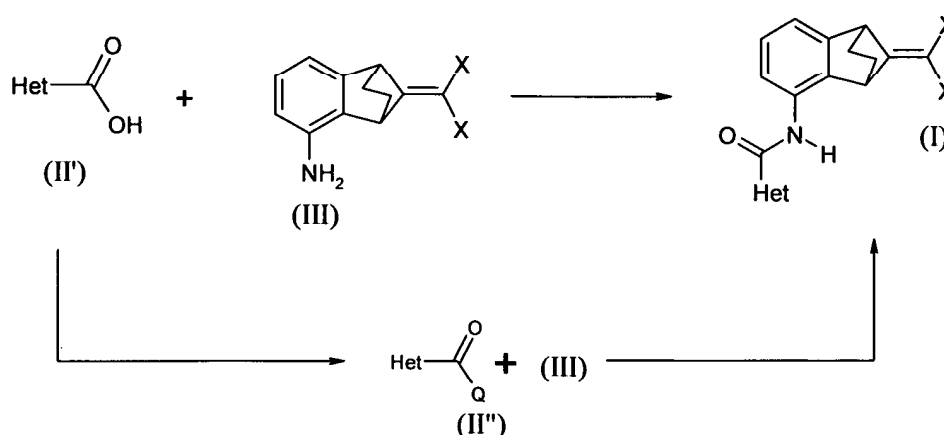


15

Som vist i skjema 1, kan en forbindelse av formel (I), hvor R_1 og X er som definert ovenfor, syntetiseres ved å reagere en forbindelse av formel (II), hvor R_1 er som definert ovenfor og R' er C_{1-5} alkyl, med et anilin av formel (III), hvor X er som definert ovenfor, i nærvær av $\text{NaN}(\text{TMS})_2$ ved -10°C til omgivelsestemperatur, fortrinnsvis i tørr THF, som beskrevet av *J. Wang et al. Synlett*, **2001**, 1485.

20

Skjema 2

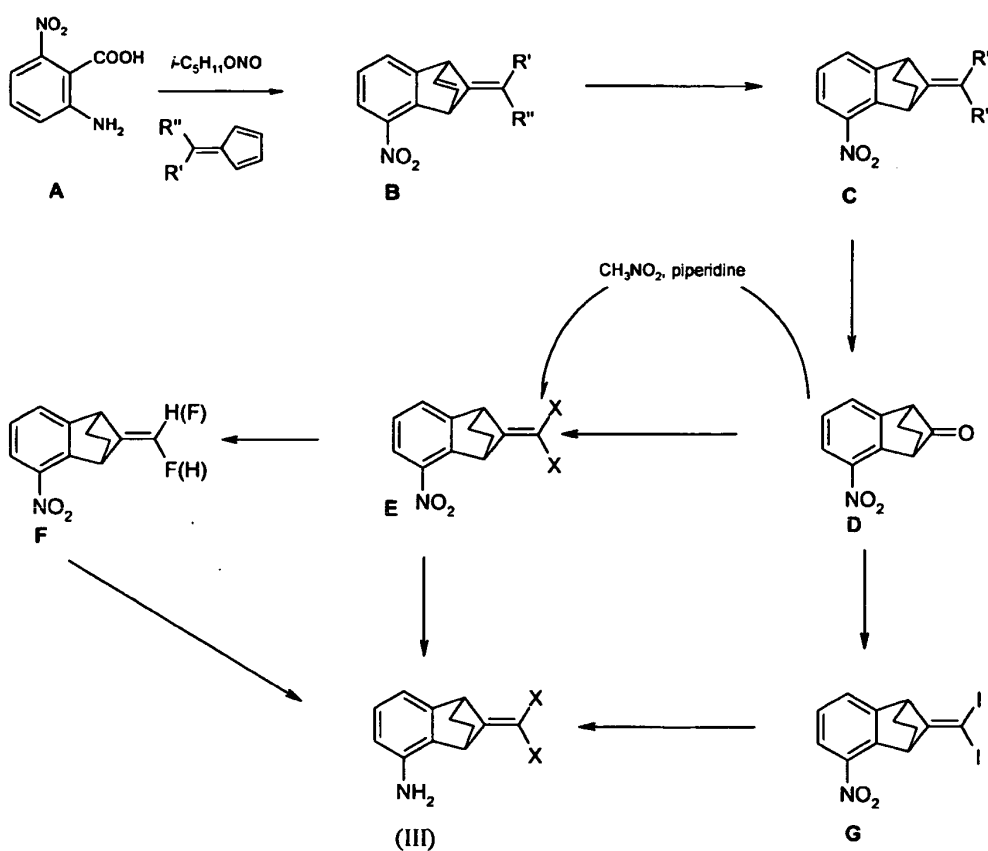


- 5 Alternativt, som vist i skjema 2, kan en forbindelse av formel (I), hvor Het er som definert i skjema 1, R₁ og X er som definert ovenfor, fremstilles ved å reagere en forbindelse av formel (II'), hvor Het er som definert ovenfor, med anilin av formel (III), hvor X er som definert ovenfor, i nærvær av et aktiverende middel, så som BOC-Cl (bis-(2-okso-3-oksazolidinyl)fosfinsyre), og to ekvivalenter
- 10 av en base, så som trietylamin, i et løsningsmiddel, så som diklormetan (som beskrevet for eksempel av J. Cabre *et al*, *Synthesis* **1984**, 413) eller ved å reagere en forbindelse av formel (II'), hvor Het er som definert ovenfor og Q er klor, fluor eller brom, med et anilin av formel (III), hvor X er som definert ovenfor, i nærvær av én ekvivalent av en base, så som trietylamin eller natrium eller
- 15 kaliumkarbonat eller bikarbonat, i et løsningsmiddel, så som diklormetan, etylacetat eller *N,N*-dimetylformamid, fortrinnsvis ved -10 til 30 °C. Forbindelsen av formel (II'') oppnås fra en forbindelse av formel (II') ved behandling med et halogenerende middel, så som tionylklorid, tionylbromid, oksalyklorid, fosgen, SF₄/HF, DAST ((dietylamo)svoveltrifluorid) eller Deoxo-Fluor®
- 20 ([bis(2metoksyetyl)amino]svoveltrifluorid) i et løsningsmiddel, så som toluen, diklormetan eller acetonitril.

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

25

Skjema 3



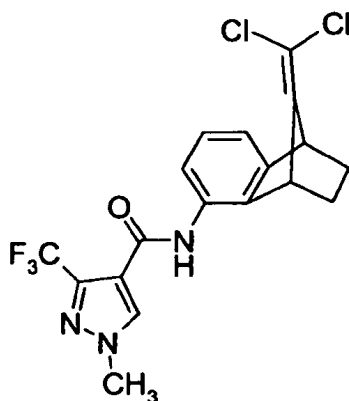
- 5 Som vist i skjema 3 kan forbindelsen av formel (III) fremstilles ved en *Bechamp* reduksjon eller ved andre etablerte fremgangsmåter, for eksempel ved selektiv katalytisk hydrogenering av nitroforbindelsene (E), (F) og (G).

9-dihalogenmetylidene-5-nitro-benzonorborene (E), hvor X er klor, brom eller fluor, kan oppnås ved *Wittig* olefinering av ketonene (D) med *in situ* generert dihalogenmetylidene fosforaner $\text{R}^3\text{P}=\text{C}(\text{R}^4)\text{R}^5$, hvor R^3 er trifenyl, tri C_{1-4} alkyl eller tridimetylamin og X er halogen, i henhold til, eller i analogi med, fremgangsmåten 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 av formel (I) kan oppnås som beskrevet i eksemplene H1 til H7.

EKSEMPEL 1

5 Dette eksemplet illustrerer fremstillingen av 1-metyl-3-trifluormetyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre(9-diklormetylen-benzonorboren-5-yl)amid (forbindelse A-1.4):

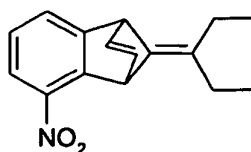


9-diklormetylen-5-amino-benzonorboren (175 mg, 0.729 mmol, fremstilt som beskrevet i eksempel 6) i diklormetan (10 ml) ble omsatt med 1-metyl-3-trifluormetyl-1H-pyrazol-karboksylysyre (170 mg, 0,874 mmol, 1,2 ekv.) i nær-
 10 vær av bis-(2-okso-3-oksazolidinyl)-fosfinsyreklorid (278 mg, 1,09 mmol, 1,5 ekv.) og trietylamin (184 mg, 1,821 mmol, 2,5 ekv.) ved omgivelsestemperatur under omrøring i 23 timer. Reaksjonsblandingen ble ekstrahert med mettet natriumbikarbonatoppløsning og mettet saltvannsoppløsning, tørket over Na₂SO₄
 15 og rensert på silikagel i etylacetat-hexan (1:1). Det ble oppnådd 210 mg (69 % av teoretisk) av 1-metyl-3-trifluormetyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre(9-diklormetylen-benzonorboren-5-yl)amid (forbindelse A-1.4, smp. 179-181 °C).

20

EKSEMPEL 2

Dette eksemplet illustrerer fremstillingen av 9-(3-pentyliden)-5-nitro-benzonorborenadien:



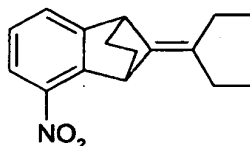
25

- Til en godt omrørt oppløsning av isopentylnitritt (2,31 ml, 1,3 ekv.) i dimetoksyetan (50 ml) ved 58 °C ble en blanding av 6-nitroantranilsyre (2,76 g, 1 ekv.) og 6,6-dietylfulven (6,45 g av 79 % renhet, 2,5 ekv.) oppløst i 25 ml dimetoksyetan tilsatt dråpevis i løpet av 8 minutter mens temperaturen steg til 67 °C.
- 5 Etter 30 minutter ble den mørke reaksjonsblanding inndampet 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 illustrerer fremstillingen av 9-(3-pentyliden)-5-nitro-benzonorbornen:

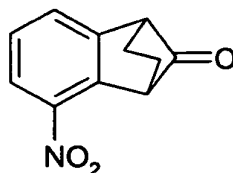


15

- 9-(3-pentyliden)-5-nitro-benzonorbornadien (7,97 g fremstilt som beskrevet i Eksempel 2) i THF (70 ml) ble hydrogenert ved 20 °C i nærvær av Rh(PPh₃)₃Cl (*Wilkinson's* katalysator: 0,8 g). Reaksjonen opphørte etter opptak av én ekvivalent hydrogen. Inndampning og filtrering av råproduktet på silikagel i etylacetat-hexan-(100:2) ga det ønskede produktet som en olje (7,90 g) som størknet ved
- 20 henstand ved romtemperatur (smp. 69–56 °C).

EKSEMPEL 4

- 25 Dette eksemplet illustrerer fremstillingen av 9-okso-5-nitro-benzonorbornen



- 9-(3-pentyliden)-5-nitro-benzonorbornen (7,0 g, 27,2 mmol; fremstilt som beskrevet i Eksempel 3) oppløst i diklormetan (300 ml) og metanol (5 ml) ble ozonbehandlet (2,8 l O₂/min., 100 Watt, tilsvarende 9,7 g O₃/t) ved -70 °C inntil
- 30 en vedvarende blåfarge ble observert (etter ca. 15 minutter). Reaksjonsblan-

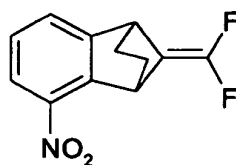
dingen ble spylt med nitrogengass. Trifenylfosfin (8,4 g, 32,03 mmol, 1,18 ekv.) ble tilsatt og temperaturen ble tillatt å oppvarmes til 20–25 °C. Etter avdampning av løsningsmidlet ble resten rensert på silikagel i heksan-EtOAc-3:1 for å gi 5,2 g av forbindelse 36.01 (smp. 112–114°C).

5

EKSEMPEL 5

Dette eksemplet illustrerer fremstillingen av 9-difluormetyliden-5-nitrobenzonorbornen

10



Til en oppløsning av dibromdifluormetan (6,30 g, 30 mmol) ved 0 °C i THF (50 ml) ble det tilsatt tris-(dimetylamino)-fosfan (10.1 g ved 97 %, ekvivalent med 11,2 ml, 60 mmol) i THF (30 ml) i løpet av 20 minutter. Til den resulterende suspensjonen ble det, etter omrøring i 1 time ved romtemperatur, dråpevis tilsatt en oppløsning av 9-okso-5-nitro-benzonorbornen (6,10 g, 30 mmol; fremstilt som beskrevet i Eksempel 4) i THF (20 ml) i løpet av 25 minutter, etterfulgt av omrøring i 21 timer. Suspensjonen ble hullet på isvann og ekstrahert med etylacetat. Rensing på silikagel i etylacetat-heksan-(1:4) ga 4,675 g 9-difluormetyliden-5-nitro-benzonorbornen (smp. 99–101 °C).

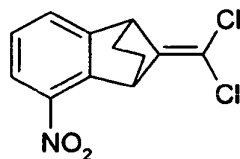
15

20

EKSEMPEL 6

Dette eksemplet illustrerer fremstillingen av 9-diklormetyliden-5-nitrobenzonorbornen

25



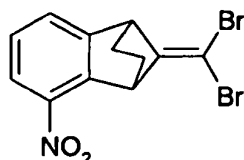
30

Tørr karebontetraklorid (5,9 g, 33 mmol) ble omsatt med trifenylfosfin (14,46 g, 55.1 mmol) i diklormetan (30 ml) ved romtemperatur i 1 time. 9-okso-5-

nitrobenzonorbornen (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 ekstraksjon med diklormetan ble råproduktet rensert på silikagel i etylacetat-heksan-(1:4) for å oppnå det ønskede 9-diklormetylidene-5-nitro-benzonorbornen (1,83 g; smp. 136–137 °C). Noe utgangsmateriale (4,06 g) ble gjenvunnet.

EKSEMPEL 7

10 Dette eksemplet illustrerer fremstillingen av 9-dibrommetylidene-5-nitrobenzonorbornen



Karbontetrabromid (4,66 g ved 98 %, 13,8 mmol) ble omsatt under omrøring med trifenylfosfin (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 ekstraksjon med diklormetan etterfulgt av kolonnekromatografi (etylacetat-heksan-(1:9) av råproduktet ga det ønskede produktet 9-dibrommetylidene-5-nitrobenzonorbornen (2,1 g, smp. 153–155 °C).

Tabell 1

25 Tabell 1 viser smeltepunkt og NMR-data, alle med CDCl₃ som løsningsmiddel, med mindre annet er angitt, for forbindelser av formel (I). I tabellen er temperaturer gitt i grader celsius, "NMR" betyr kjernemagnetisk resonansspektrum og følgende forkortelser anvendes:

30	smp. = smeltepunkt	b.p. = kokepunkt
	s = singlett	br = bred
	d = dublett	dd = dobbeldubletter
	t = triplett	k = kvartett
	m = multiplt	ppm = deler per million
	THF = tetrahydrofuran	

Forbindelse	smp. (°C)	¹ H-NMR protonskift δ (ppm) (CDCl ₃)
A-1.1	179–181	8,06 (s,1H), 7,69 (d overlappet ved brd signal, utbyttbart med D ₂ 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, utbyttbart med D ₂ 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, 1H), 7,68 (brd, utbyttbart med D ₂ 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, utbyttbart med D ₂ O, 1H), 7,39 (brd s, 1H), 7,16 (t, 1H), 7,01 (d overlappet fra 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, utbyttbart med D ₂ 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, utbyttbart med D ₂ 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) ("fluopyram") er kjent og registrert under CAS-Reg. Nr: 658066-35-4 og beskrevet i WO 04/16088.

5

Sammensetningene ifølge oppfinnelsen er effektive mot skadelige mikroorganismer, så som mikroorganismer som forårsaker fytopatogene sykdommer, spesielt mot fytopatogene sopp og bakterier.

10 Sammensetningene ifølge oppfinnelsen er effektive spesielt mot fytopatogene sopp tilhørende følgende klasser: Ascomycetes (for eksempel *Venturia*, *Podosphaera*, *Erysiphe*, *Monilinia*, *Mycosphaerella*, *Uncinula*); Basidiomycetes (for

eksempel slekten *Hemileia*, *Rhizoctonia*, *Phakopsora*, *Puccinia*, *Ustilago*, *Tilletia*); Fungi imperfecti (også kjent som Deuteromycetes, for eksempel *Botrytis*, *Helminthosporium*, *Rhynchosporium*, *Fusarium*, *Septoria*, *Cercospora*, *Alternaria*, *Pyricularia* og *Pseudocercosporia*); Oomycetes (for eksempel *Phytophthora*,
 5 *Peronospora*, *Pseudoperonospora*, *Albugo*, *Bremia*, *Pythium*, *Pseudosclerospora*, *Plasmopara*).

I henhold til oppfinnelsen omfatter "nytteplanter" typisk følgende arter av planter:

10 vindruer; cerealer, så som hvete, bygg, rug og havre; roer, så som sukkerroer eller fôrroer; frukter, så som kjernefrukter, stenfrukter eller myke frukter, f.eks. epler, pærer, plommer, ferskener, mandler, kirsebær, jordbær, bringebær eller bjørnebær; belgplanter, så som bønner, linser, erter eller soyabønner; oljeplanter, så som raps, sennepsfrø, valmue, oliven, solsikke, kokosnøtt, ricinusolje-
 15 planter, kakaobønner eller jordnøtter; agurkplanter, så som gresskar, agurker eller meloner; fiberplanter, så som bomull, lin, hamp eller jute; sitrusfrukt, så som appelsiner, sitroner, grapefrukt eller mandariner; grønnsaker, så som spinat, bladsalat, asparges, kål, gulrøtter, løk, tomater, poteter, gresskarplanter eller paprika; laurbærfamilien, så som avokado, kanel eller kamfer; mais; to-
 20 bakk; nøtter; kaffe; sukkerroer; te; viner; humle; durian; bananer; naturgummiplanter; torv eller ornamentale planter, så som blomster, busker, bredbladede trær eller eviggrønne trær, for eksempel nåletrær. Denne listen utgjør ingen begrensning.

25 Betegnelsen "nytteplanter" skal forstås som omfattende også nytteplanter som er gjort tolerante overfor herbicider som bromoksynil eller klasser av herbicider (så som for eksempel HPPD-inhibitorer, ALS-inhibitorer, for eksempel primisulfuron, prosulferon og trifloksysulfuron, EPSPS (5-enol-pyrovyl-shikimate-3-fosfat-syntase) inhibitorer, GS (glutamin syntetase) inhibitorer eller PPO (protoporfyrinogen-oksidas)inhibitorer) som et resultat av konvensjonelle dyrkningsfremgangsmåter eller genteknologi. Et eksempel på en avling som er gjort tolerant overfor imidazolinoner, for eksempel imazamoks, ved konvensjonelle dyrkningsmetoder (mutagenese) er Clearfield® sommerraps (Canola). Eksempler på
 30 avlinger som er gjort tolerante overfor herbicider eller klasser av herbicider ved
 35 genteknologiske fremgangsmåter, omfatter glyfosat- og glufosinatresistente

maisvarianter som er vanlig tilgjengelig under varemerkene RoundupReady®, Herculex I® og LibertyLink.

- 5 Betegnelsen "nytteplanter" skal forstås som innbefattende også nytteplanter som er transformert ved anvendelse av rekombinant DNA-teknikk på en slik måte at de er i stand til å syntetisere ett eller flere selektivt virkende toksiner, som er kjent for eksempel fra toksinproduserende bakterier, spesielt de av slekten *Bacillus*.
- 10 Betegnelsen "nytteplanter" skal forstås som innbefattende også nytteplanter som er transformert ved anvendelse av rekombinante DNA-teknikker på en slik måte at de er i stand til å syntetisere antipatogene stoffer som har en selektiv virkning, så som for eksempel de såkalte "patogeneserelaterte proteinene" (PRP-er, se for eksempel EP-A-0 392 225). Eksempler på slike antipatogene stoffer og
- 15 transgene planter som er i stand til å syntetisere slike antipatogene stoffer, er kjente for eksempel fra EP-A-0 392 225, WO95/33818 og EP-A-0 353 191. Fremgangsmåtene for å fremstille slike transgene planter er generelt kjente for fagpersonen og er for eksempel beskrevet i publikasjonene nevnt ovenfor.
- 20 Betegnelsen "lokasjon" for en nytteplante som er anvendt heri, er ment å omfatte stedet hvor nytteplantene gror, hvor planteformeringsmateriale sås og hvor planteformeringsmaterialene av nytteplantene vil bli plassert i jorden. Et eksempel på en slik lokasjon er et felt hvor avlingsplanter gror.
- 25 Betegnelsen "planteformeringsmateriale" er underforstått å angi generative deler av planten, så som frø, som siden kan anvendes for formering av sistnevnte, og vegetativt materiale, så som avkutt eller knoller, for eksempel poteter. Det kan nevnes for eksempel frø (i streng forstand), røtter, frukter, rotknoller, knoller, jordstengler og deler av planter. Spirende planter og unge planter som skal for-
- 30 flyttes etter spiring eller etter gjennombrudd fra jorden, kan også nevnes. Disse unge plantene kan beskyttes før forflytning ved en total eller delvis behandling ved neddykking. Fortrinnsvis skal "planteformeringsmaterialet" forstås å betegne frø.
- 35 Sammensetningene ifølge oppfinnelsen kan også anvendes innen feltet beskyttelse av lagringsvarer mot angrep av sopp. I henhold til den foreliggende oppfin-

nelse skal betegnelsen "lagringsvarer" forstås å betegne naturstoffer av vegetabilsk og/eller animalsk opphav og deres bearbeidede former, som er tatt fra den naturlige livssyklusen og for hvilke langvarig beskyttelse er ønsket. Lagringsvarer av vegetabilsk opphav, så som planter eller deler derav, for eksempel stilker, blader, rotknoller, frø, frukter eller korn, kan beskyttes i nyhøstet tilstand eller i bearbeidet form, så som fortørket, fuktet, findelt, malt, presset eller brent. Noe som også faller under definisjonen av lagringsvarer er tømmer, enten i form av råtømmer, så som konstruksjonstømmer, elektrisitetsmaster eller barrierer, eller i form av ferdige gjenstander, så som møbler eller gjenstander fremstilt av tre. Lagringsvarer av animalsk opphav er hud, lær, pels, hår og lignende. Sammensetningene ifølge den foreliggende oppfinnelse kan forebygge uheldige effekter som nedbrytning, misfarging eller mugg. Fortrinnsvis forstås "lagringsvarer" å betegne naturstoffer av vegetabilsk opphav og/eller deres bearbeidede former, mer foretrukket frukter og deres bearbeidede former, så som eplefrukter, stenfrukter, myke frukter og sitrusfrukter og deres bearbeidede former. I en annen foretrukket utførelsesform av oppfinnelsen forstås "lagringsvarer" å betegne tre.

Et ytterligere trekk ved den foreliggende oppfinnelse er derfor en fremgangsmåte for beskyttelse av lagringsvarer, som omfatter påføring på lagringsvarene av en sammensetning ifølge oppfinnelsen.

Sammensetningene ifølge den foreliggende oppfinnelse kan også anvendes innen feltet beskyttelse av et teknisk materiale mot angrep av sopp. I henhold til den foreliggende oppfinnelse omfatter betegnelsen "teknisk materiale" papir; tepper; konstruksjonsmaterialer; kjøle- og oppvarmingssystemer; veggplater; ventilasjon og luftkondisjoneringssystemer og lignende; fortrinnsvis forstås "teknisk materiale" å betegne veggplater. Sammensetningene ifølge den foreliggende oppfinnelse kan forebygge uheldige effekter så som nedbrytning, misfarging eller mugg.

Sammensetningene ifølge oppfinnelsen er spesielt effektive mot mjøldugg; rustsopper; bladflekkysyke-specier; tidlige plantesykdommer og muggtyper; spesielt mot Septoria, Puccinia, Erysiphe, Pyrenophora og Tapesia i cerealer; Phakopsora i soyabønner; Hemileia i kaffe; Phragmidium i roser; Alternaria i poteter, tomater og gresskarplanter; Sclerotinia i torv, grønnsaker, solsikke og oljefrø raps;

svartråte, rødbrann, mjøldugg, gråsopp og "dead arm"-sykdom i vinranke; *Botrytis cinerea* in frukter; *Monilinia* spp. i frukter og *Penicillium* spp. i frukter.

Sammensetningene ifølge oppfinnelsen er videre spesielt effektive mot frøbårne og jordbårne sykdommer, så 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., *Prenophora graminea*, *Pyricularia oryzae*, *Rhizoctonia solani*, *Rhizoctonia cerealis*, *Sclerotinia* spp., *Septoria* spp., *Sphacelotheca reilliana*, *Tilletia* spp., *Typhula incarnata*, *Urocystis occulta*, *Ustilago* spp. eller *Verticillium* spp.; spesielt mot patogener av cerealer, så som hvete, bygg, rug eller havre; mais; ris; bomull; soyabønne; torv; sukkerroer; oljefrørops; poteter; belgfruktavlinger, så som erter, linser eller kikerter; og solsikke.

- 15 Sammensetningene ifølge oppfinnelsen er videre spesielt effektive mot etterinnhøstingssykdommer, så 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* spesielt mot patogener av frukter, så som eplefrukter, for eksempel epler og pærer, stenfrukter, for eksempel ferskener og plommer, sitrus, meloner, papaya, kiwi, mango, bær, for eksempel jordbær, avokado, granatepler og bananer og nøtter.

Sammensetningene ifølge oppfinnelsen er spesielt nyttige for å kontrollere følgende sykdommer på følgende avlinger:

- 25 *Alternaria* specier i frukt og grønnsaker; *Ascochyta* specier i belgfrukter; *Botrytis cinerea* i jordbær, tomater, solsikke, belgfruktavlinger, grønnsaker og druer, så som *Botrytis cinera* på druer; *Cercospora arachidicola* i peanøtter; *Cochliobolus sativus* i cerealer; *Colletotrichum* specier i belgfruktavlinger; *Erysiphe* specier i cerealer; så som *Erysphe graminis* på hvete og *Erysiphe graminis* på bygg; *Erysiphe cichoracearum* og *Sphaerotheca fuliginea* i gresskarplanter; *Fusarium* specier i cerealer og mais; *Gäumannomyces graminis* i cerealer og plener; *Helminthosporium* specier i mais, ris og poteter; *Hemileia vastatrix* på kaffe; *Midrodochium* specier i hvete og rug; *Mycosphaerella fijiensis* i bananer; *Phakopsora* specier i soyabønner, så som *Phakopsora pachyrizi* i soyabønner; *Puccinia* specier i cerealer, bredbladede avlinger og flerårige planter; så som *Puccinia recon-*

dita på hvete, *Puccinia striiformis* på hvete og *Puccinia recondita* på rug; *Pseudocercospora* specier i cerealer, så som *Pseudocercospora herpotrichoides* i hvete; *Phragmidium mucronatum* i roser; *Podosphaera* specier i frukter; *Pyrenophora* specier i bygg; så som *Pyrenophora teres* på bygg, *Pyricularia oryzae* i ris; *Ramularia collo-cygni* i bygg; *Rhizoctonia* specier i bomull, soyabønne, ce-
 5 realer, mais, poteter, ris og plener, så som *Rhizoctonia solani* på poteter, ris, torv og bomull; *Rhynchosporium secalis* på bygg; *Rhynchosporium secalis* på rug; *Sclerotinia* specier i plener, bladsalat, grønnsaker og oljefrørops, så som *Sclerotinia sclerotiorum* på oljefrørops og *Sclerotinia homeocarpa* på torv; *Septoria* specier i cerealer, soyabønner og grønnsaker, så som *Septoria tritici* på hve-
 10 te, *Septoria nodorum* på hvete og *Septoria glyciner* på soyabønner; *Sphacelotheca reilliana* i mais; *Tilletia* specier i cerealer; *Ucinula necator*, *Guignardia bidwellii* og *Phomopsis viticola* i vinranker; *Urocystis occulta* i rug; *Uromyces* specier i bønner; *Ustilago* specier i cerealer og mais; *Venturia* specier i frukter, så som *Venturia inequalis* på epler; *Monilinia* specier på frukter; *Penicillium* spe-
 15 cier på sitrus og epler.

Generelt er vektforholdet mellom komponent (A) og komponent (B) fra 2000 : 1 til 1 : 1000. Et ikke-begrensende eksempel på slike vektforhold er hvor forbindelse med formel I: 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 funnet at visse vektforhold mellom komponent (A) og komponent (B) er i stand til å gi opphav til synergistisk aktivitet. Et ytterligere trekk ved oppfinnelsen er følgende sammensetninger hvori komponent (A) og komponent (B) er tilstede i sammensetningen i mengder som gir en synergistisk effekt. Denne synergistiske aktiviteten fremgår fra det faktum at den fungicidiske aktiviteten av sammensetningen omfattende komponent (A) og komponent (B) er større enn summen av de fungicidiske aktivitetene for komponent (A) og komponent (B). Denne synergistiske aktiviteten utvider virkningsområdet til komponent (A) og komponent (B) på to måter. For det første er påføringsratene for komponent (A) og komponent (B) nedsatt mens virkningen forblir like god, hvilket betyr at blandingen av aktiv bestanddel fremdeles oppnår en høy grad av
 30 fytopatogen kontroll selv når de to individuelle komponentene er blitt totalt inef-
 35

fektive i et slikt lavt område for påføringsrate. For det andre er det en vesentlig utvidelse av spekteret av fytopatogener som kan kontrolleres.

5 En synergistisk effekt foreligger når virkningen av en aktiv bestanddelskombinasjon er større enn summen av virkningene av de individuelle komponentene. Virkningen som kan forventes E for en gitt aktiv bestanddelskombinasjon adlyder den såkalte COLBY-formelen og kan beregnes som følger (COLBY, S.R. "Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide combination". Weeds, Vol. 15, sidene 20–22, 1967):

10 ppm = milligram aktiv bestanddel (=a.i.) pr. liter sprayblanding

X = % virkning ved aktiv bestanddel A) ved anvendelse av p ppm aktiv bestanddel

Y = % virkning av aktiv bestanddel B) ved anvendelse av q ppm aktiv bestanddel.

15 I henhold til COLBY, er den ventede (additive) virkningen av aktive bestanddeler A)+B) ved anvendelse av p+q ppm aktiv bestanddel

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

20 Dersom virkningen som reelt observeres (O) er større enn den ventede virkningen (E), er virkningen av kombinasjonen superadditiv, dvs. det foreligger en synergistisk effekt. Uttrykt matematisk tilsvarer synergisme en positiv verdi for differansen av (O-E). I tilfellet med en rent komplementær addisjon av aktiviteter (ventet aktivitet) er nevnte forskjell (0-1) lik null. En negativ verdi av nevnte forskjell (O-E) angir et tap av aktivitet sammenlignet med den forventede aktiviteten.

25

Imidlertid kan, ved siden av den reelle synergistiske virkningen med hensyn til fungicidisk aktivitet, 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 oppførsel; eller forbedrede egenskaper for nytteplantene innbefattende: tilsynekomst, avlingsutbytte, mer utviklet rotsystem; rotkulturforbedring, økning i plantehøyde, større blader, mindre døde basalblader, sterkere rotsystem, grønnere bladfarge, mindre gjødningsmidler påkrevet, mindre frø er påkrevet, mer produktivt rotsystem, tidligere blomstring, tidligere

30

35

kornmodning, mindre planteledning, forøket skuddvekst, forbedret plantekraft og tidlig spiring.

5 Noen sammensetninger ifølge oppfinnelsen har en systemisk virkning og kan anvendes som bladverk, jord- og frøbehandlingsfungicider.

10 Med sammensetningene ifølge oppfinnelsen er det mulig å inhibere eller ødelegge de fytopatogene mikroorganismene som opptrer i planter eller i deler av planter (frukt, blomster, blad, stammer, rotknoller, røtter) i forskjellige nytteplanter, mens samtidig delene av plantene som gror senere også beskyttes mot angrep ved fytopatogene mikroorganismer.

15 Sammensetningene ifølge oppfinnelsen kan påføres på de fytopatogene mikroorganismene, nytteplantene, voksestedet for disse, formeringsmaterialet for disse, lagringsvarer eller tekniske materialer som er utsatt for mikroorganismeangrep.

20 Sammensetningene ifølge oppfinnelsen kan påføres før eller etter infeksjon av nytteplantene, forplantningsmaterialene derfor, lagringsvarer eller tekniske materialer forårsaket av mikroorganismene.

25 Mengden av sammensetningen ifølge oppfinnelsen som skal påføres vil avhenge av forskjellige faktorer, så som de anvendte forbindelsene; gjenstanden for behandlingen, så som for eksempel planter, jord eller frø; typen behandling, så som for eksempel spraying, støving eller frøbelegging; formålet med behandlingen, så som for eksempel profylaktisk eller terapeutisk; type sopp som skal kontrolleres og påføringstidspunktet.

30 Når det påføres på nytteplantene, blir komponent (A) typisk påført ved en rate på 5 til 2000 g a.i./ha, spesielt 10 til 1000 g a.i./ha, for eksempel 50, 75, 100 eller 200 g a.i./ha, typisk i forbindelse med 1 til 5000 g a.i./ha, spesielt 2 til 2000 g a.i./ha, for eksempel 100, 250, 500, 800, 1000, 1500 g a.i./ha av komponent (B).

35 I jordbrukspraksis avhenger påføringsratene av sammensetningene ifølge oppfinnelsen av typen effekt som ønskes, og varierer typisk fra 20 til 4000 g total sammensetning per hektar.

Når sammensetningen ifølge oppfinnelsen anvendes for behandling av frø, er rater på 0,001 til 50 g av en forbindelse av komponent (A) pr. kilo frø, fortrinnsvis fra 0,01 til 10 g per kilo frø, og 0,001 til 50 g av en forbindelse av komponent (B) per kilo frø, fortrinnsvis fra 0,01 til 10 g per kilo frø, generelt tilstrekkelig.

Sammensetningen ifølge oppfinnelsen kan anvendes i en hvilken som helst konvensjonell form, for eksempel i form av en dobbeltpakke, et pulver for tørr frøbehandling (DS), en emulsjon for frøbehandling (ES), et flytbart konsentrat for frøbehandling (FS), en oppløsning for frøbehandling (LS), et vandig dispergerbart pulver for frøbehandling (WS), en kapselsuspensjon for frøbehandling (CF), en gel for frøbehandling (GF), et emulsjonskonsentrat (EC), et suspensjonskonsentrat (SC), en suspo-emulsjon (SE), en kapselsuspensjon (CS), et vanddispergerbart korn (WG), et emulgerbart korn (EG), en emulsjon, vann-i-olje (EO), en emulsjon, olje-i-vann (EW), en mikroemulsjon (ME), en oljedispersjon (OD), et oljeblandbart "flowable" (OF), en oljeblandbar væske (OL), et oppløselig konsentrat (SL), en ultralav volumsuspensjon (SU), en ultralav volumvæske (UL), et teknisk konsentrat (TK), et dispergerbart konsentrat (DC), et fuktbart pulver (WP) eller en hvilken som helst teknisk tenkelig formulering i kombinasjon med adjuvanter som er akseptable innen jordbruk.

Slike sammensetninger kan fremstilles på konvensjonell måte, for eksempel ved å blande de aktive bestanddelene med minst én egnet inert formuleringsadjuvant (for eksempel fortynningsmidler, løsningsmidler, fyllstoffer og eventuelt andre formuleringsbestanddeler så som surfaktanter, biocider, antifrysetilsetninger, klebriggjørende midler, fortykningsmidler og forbindelser som tilveiebringer adjuvanseffekter). Også konvensjonelle formuleringer med langsom frigivelse kan anvendes der hvor langvarig virkningseffekt er ønsket. Spesielt kan formuleringer som skal påføres i sprayformer, så som vandig dispergerbare konsentrater (for eksempel EC, SC, DC, OD, SE, EW, EO og lignende), fuktbare pulvere og granuler, inneholde surfaktanter så som fuktende og dispergerende midler og andre forbindelser som tilveiebringer adjuvanseffekter, for eksempel kondensasjonsproduktet av formaldehyd med naftalensulfonat, et alkylarylsulfonat, et ligninsulfonat, et fettalkylsulfat og etoksyliert alkylfenol og et oksyliert fettalkohol.

Sammensetningene ifølge oppfinnelsen kan også omfatte ytterligere pesticider, så som for eksempel fungicider, insekticider eller herbicider.

- 5 En frøbeisingsformulering påføres på kjent måte på frøene ved anvendelse av sammensetningene ifølge oppfinnelsen og et fortynningsmiddel i egnet frøbeisingsformulering, for eksempel som en vandig suspensjon eller i en tørr pulverform som har godt vedheng til frøene. Slike frøbeisingsformuleringer er kjente innen teknikken. Frøbeisingsformuleringer kan inneholde enkle aktive bestanddeler eller kombinasjonene av aktive bestanddeler i innkapslet form, for eksempel som kapsler eller mikrokapsler med langsom frigivelse.

15 Generelt omfatter formuleringene fra 0,01 til 90 vekt-% aktivt middel, fra 0 til 20% jordbruksakseptabel surfaktant og 10 til 99,99 % av faste eller flytende formuleringer inneholdende bestanddeler og adjuvanter, idet den aktive bestanddelen består av minst en forbindelse av komponent (A) sammen med en forbindelse av komponent (B), og eventuelt andre aktive midler, spesielt mikrobiocider og konserveringsmidler eller lignende. Konsentrerte former av sammensetninger inneholder generelt mellom 2 og 80 %, fortrinnsvis mellom 5 og 70 vekt-% aktivt middel. Påføringsformer av formulering kan for eksempel inneholde fra 0,01 til 20 vekt-%, fortrinnsvis fra 0,01 til 5 vekt-% aktivt middel. Mens kommersielle produkter fortrinnsvis vil bli formulert som konsentrater, vil sluttbruker normalt anvende fortynnede formuleringer.

- 25 Fremgangsmåtene ifølge oppfinnelsen tillater også god kontroll av andre skadelige sopp som ofte opptrer i soyabønneplanter. De viktigste soppsykdommene i soyabønner er *Phakopsora pachyrhizi*, *Microsphaera diffusa*, *Cercospora kikuchi*, *Cercospora sojina*, *Septoria glycines* og *Colletotrichum truncatum*, hvorav visse omfatter det såkalte "sensesong sykdomskomplekset" og videre *Rhizoctonia solani*, *Corynespora cassicola*, *Sclerotinia sclerotiorum* og *Sclerosium rolfsii*.

35 Som beskrevet ovenfor for betegnelsen "nytteplante" omfatter betegnelsen "soyabønneplante" alle soyabønneplanter og alle varianter, innbefattende transgene planter. Betegnelsen "soyabønneplante" omfatter spesielt glyfosattolerante soyabønneplanter.

- Med "glyfosattolerante" menes at plantene for anvendelse i fremgangsmåtene er resistente overfor glyfosatpåføring eller tolerante overfor glyfosat. Glyfosattolerante planter er gjort tolerante overfor glyfosat ved konvensjonell foredling eller har vært utsatt for en transgen hendelse som tilveiebringer glyfosat resistens.
- 5 Noen eksempler på slike foretrukne transgene planter som har 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 4.940.835. Anvendelsen av "oppnopede" transgene hendelser i plantene er også overveid.
- 10 Oppnopede transgene hendelser innbefatter ytterligere herbicid-resistente trekk, så som resistens overfor HPPD-inhibitorer, sulfonylureaer, glufosinat og bromoksynil er meget anvendt og er beskrevet i lett tilgjengelige ressurser. De oppnopede transgene hendelsene kan også være rettet mot andre pesticid-resistente trekk, så som insekticid, nematicid, fungicid, også videre resistens, som kan
- 15 oppnås ved konvensjonell dyrking eller ved å innføre en transgen hendelse. Linjer av transgene glyfosattolererbare avlingsplanter som er overveiende for anvendelse av fremgangsmåtene ifølge oppfinnelsen, omfatter for eksempel Roundup Ready®Soybean 40-3-2.
- 20 En "transgen plante" refererer til en plante som inneholder genetisk materiale som ikke finnes (dvs. "eksogen") i en villtype-plante av samme specie, sort eller kultivar. Det genetiske materialet kan omfatte et transgen, en innskuddsmutagenese-hendelse (så som ved transposon eller T-DNA-innskuddsmutagenese), en aktiveringsmerkesekvens, en mutert sekvens, en homolog rekombinant hendelse eller en sekvens modifisert ved chimeroplasti. Typisk er det fremmede genetiske materialet innført i planten ved menneskelig manipulering, men en hvilken som helst fremgangsmåte kan anvendes som fagmannen vil kjenne til. En transgen plante kan inneholde en ekspresjonsvektor eller kasset. Ekspresjonskassetten omfatter typisk en polypeptidkodende sekvens som er operabelt forbundet (dvs. er under regulatorisk kontroll av) egnede induserbare eller konstitutive regulatoriske sekvenser som tillater ekspresjonen av polypeptidet. Ekspresjonskassetten kan innføres i en plante ved transformasjon eller ved foredling etter transformasjon av en morplante. Som beskrevet tidligere, refererer en plante til en hel plante, innbefattende kimplanter og modne planter, så vel som
- 30 en plantedel, så som frø, frukt, blad eller rot, plantevev, planteceller eller et hvilket som helst annet plantemateriale, for eksempel et planteeksplantat, så vel

som avkommet derav, og in vitro systemer som etterligner de biokjemiske eller cellulære komponenter eller prosesser i en celle.

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

Formuleringseksempler

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

- Den aktive bestanddelen blandes grundig med de andre formuleringskomponentene og blandingen males omhyggelig i en egnet mølle, idet det oppnås fuktbare pulvere som kan fortynnes med vann for å gi suspensjoner av den ønskede konsentrasjonen.
 20

	a)	b)
<u>Pulvere for tørrfrøbehandling</u>		
aktiv bestanddel [A] : B) = 1:3(a), 1:1(b)]	25 %	75 %
lett mineralolje	5 %	5 %
25 høydispergert kiselsyre	5 %	-
kaolin	65 %	-
talk	-	20

- Den aktive bestanddelen blandes grundig med de andre formuleringskomponentene og blandingen males omhyggelig i en egnet mølle, idet det oppnås pulvere som kan anvendes direkte for frøbehandling.
 30

Emulgerbart konsentrat

aktiv bestanddel (A) : B) = 1:6)	10 %
oktylfenolpolyetylenglykoleter	3 %
35 (4-5 mol etylenoksid)	
kalsiumdodecylbensensulfonat	3 %

ricinusolje polyglykoleter (35 mol etylenoksid)	4 %
cykloheksanon	30 %
xylenblanding	50 %

- 5 Emulsjoner av den påkrevde fortynning, som kan anvendes ved plantebeskyttelse, kan oppnås fra dette konsentratet ved fortynning med vann.

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

Støvblandinger ferdig for bruk oppnås ved å blande den aktive bestanddelen med bærerene og male blandingen i en egnet mølle. Slike pulvere kan også anvendes for tørr belegging for korn.

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

- 20 Den aktive bestanddelen blandes og males med de andre formuleringskomponentene, og blandingen fuktes med vann. Blandingene ekstruderes og tørkes deretter i en luftstrøm.

Suspensjonskonsentrat

25 aktiv bestanddel (A) : B) = 1:8)	40 %
propylenglykol	10 %
nonylphenol polyetylenglykoleter (15 mol etylenoksid)	6 %
natriumlignosulfonat	10 %
karboksymetylcellulose	1 %
30 silikonolje (i form av en 75 % emulsjon i vann)	1 %
vann	32 %

- 35 Den finmalte aktive bestanddelen blandes omhyggelig med de andre formuleringskomponentene, idet det oppnås et suspensjonskonsentrat som kan fortynnes i vann ved en hvilken som helst ønsket rate. Ved anvendelse av slike fortynninger kan levende planter så vel som planteformeringsmateriale behandles og

beskyttes mot angrep av mikroorganismer ved spraying, helling eller neddykking.

Flytbart konsentrat for frøbehandling

5	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-on	0,5 %
10	monoazo-pigment kalsiumsalt	5 %
	silikonolje (i form av en 75 % emulsjon i vann)	0,2 %
	vann	45,3 %

Den finmalte aktive bestanddelen blandes omhyggelig med de andre formuleringskomponentene, idet det oppnås et suspensjonskonsentrat som kan fortynnes ytterligere i vann for påføring på frø. Ved anvendelse av slike fortyninger kan formeringsmaterialet behandles og beskyttes mot angrep av mikroorganismer ved spraying, helling eller neddykking.

Biologiske eksempler

20 Eksempel B1: Fungicidisk virkning mot *Gaeumannomyces graminis* (rottreper på korn):

Mycel-fragmenter av soppen fra kryogen lagring blandes direkte i næringsoppløsning (PDB potetdekstroseoppløsning). Etter plassering av en (DMSO) oppløsning av forsøksforbindelsene i en mikrotiterplate (96-brønns format) tilsettes næringsoppløsningen inneholdende soppsporene. Forsøksplatene inkuberes ved 25 24 °C og inhiberingen av veksten vurderes etter 4 dager. Resultatene er gitt i Tabellene B1:

Tabellene B1: Fungicidisk virkning mot *Gaeumannomyces graminis*:

Tabell B1.1:

Forbindelse A-1.2	Fluopyram		
ppm	ppm	% aktivitet	
0,5000		90	
0,2500		0	
	2,000	0	
	1,000	0	
	0,5000	0	
	0,2500	0	
	0,1250	0	Forventet virkning (Colby)
0,5000	2,0000	100	90
0,5000	1,0000	100	90
0,5000	0,5000	100	90
0,5000	0,1250	100	90
0,2500	0,5000	50	0
0,2500	0,2500	90	0

5

Tabell B1.2:

Forbindelse A-1.1	Fluopyram		
ppm	ppm	% aktivitet	
0,0156		70	
	0,0313	0	
	0,0156	0	
	0,0078	0	
	0,0039	0	Forventet virkning (Colby)
0,0156	0,0313	90	70
0,0156	0,0156	100	70
0,0156	0,0078	90	70
0,0156	0,0039	90	70

Eksempel B2: Fungicidisk virkning mot *Cercospora arachidicola* (syn. *Mycosphaerella arachidis*). Brun bladflekk på jordnøtt (peanøtt):

- 5 Konidier av soppen fra kryogen lagring blandes direkte i næringsoppløsning (PDB potetdekstroseoppløsning). Etter plassering av en (DMSO) oppløsning av forsøksforbindelsene i en mikrotiterplate (96-brønns format) tilsettes næringsoppløsningen inneholdende soppsporene. Forsøksplatene inkuberes ved 24 °C og inhiberingen av veksten vurderes etter 7 dager. Resultatene er gitt i Tabell B2:

Tabell B2: Fungicidisk virkning mot *Cercospora arachidicola*:

10

Tabell B2.1:

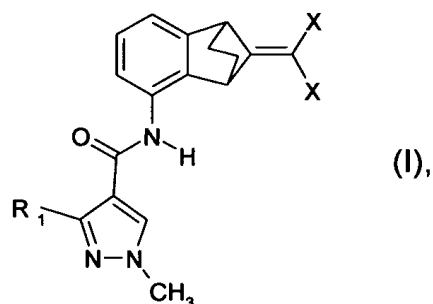
Forbindelse A-1.2	Fluopyram		
ppm	ppm	% aktivitet	
0,2500		50	
0,1250		20	
	0,2500	20	
	0,1250	20	
	0,0625	0	
	0,0313	0	Forventet virkning (Colby)
0,2500	0,2500	90	60
0,2500	0,1250	90	60
0,2500	0,0625	90	50
0,1250	0,2500	70	36
0,1250	0,1250	50	36
0,1250	0,0625	50	20
0,1250	0,0313	70	20

15

20

Patentkrav

1. Sammensetning egnet for kontroll av sykdommer forårsaket av fytopatogener, omfattende
- 5 (A) en forbindelse med formel I



- 10 hvori R_1 er difluormetyl eller trifluormetyl og X er klor, fluor eller brom; og (B) forbindelsen fluopyram.
2. Sammensetning ifølge krav 1, hvori komponent (A) er en forbindelse med formel (I), hvori R_1 er difluormetyl.
- 15 3. Sammensetning ifølge krav 1, hvori komponent (A) er en forbindelse med formel (I), hvori R_1 er difluormetyl og X er klor.
4. Sammensetning ifølge krav 1, hvori komponent (A) er en forbindelse med formel (I), hvori R_1 er difluormetyl og X er fluor.
- 20 5. Sammensetning ifølge krav 1, hvori komponent (A) er en forbindelse med formel (I), hvori R_1 er difluormetyl og X er brom.
6. Sammensetning ifølge krav 1, som omfatter som komponent (A) en forbindelse valgt fra 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre(9-diklormetylyden-benzonorboren-5-yl)amid og 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylysyre(9-difluormetylyden-benzonorboren-5-yl)amid, og som komponent (B) fluopyram.
- 25

7. Sammensetning ifølge krav 1, som omfatter som komponent (A) forbindelsen 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylsyre(9-diklormetylidenebenzonorbornen-5-yl)amid og som komponent (B) fluopyram.
- 5 8. Sammensetning ifølge krav 1, som omfatter som komponent (A) forbindelsen 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylsyre(9-difluormetylidenebenzonorbornen-5-yl)amid og som komponent (B) fluopyram.
9. Sammensetning ifølge krav 1, hvori vektforholdet mellom (A) og (B) er fra
10 2000 : 1 til 1 : 1000.
10. Fremgangsmåte for å kontrollere sykdommer på nytteplanter eller på formeringsmaterialer derav forårsaket av fytopatogener, som omfatter å påføre på nytteplantene, på voksestedet for disse eller formeringsmaterialet derav, en
15 sammensetning ifølge krav 1.
11. Fremgangsmåte for å kontrollere sykdommer på soyabønneplanter forårsaket av fytopatogener, som omfatter å påføre på soyabønneplantene eller deres voksested, en sammensetning ifølge krav 1.
20
12. Fremgangsmåte ifølge krav 11, hvori fytopatogenet er *Phakopsora pachyrhizi*.