



(12) **Øversettelse av
europeisk patentskrift**

(11) **NO/EP 2204093 B1**

NORGE

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

Patentstyret

- (21) Oversettelse publisert 2012.01.23
- (80) Dato for Den Europeiske Patentmyndighets publisering av det meddelte patentet: 2011.09.07
- (86) Europeisk søknadsnr: 10157584.3
- (86) Europeisk innleveringsdag 2008.04.23
- (87) Den europeiske søknadens Publiseringsdato 2010.07.07
- (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 Tandbergs Patentkontor AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

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

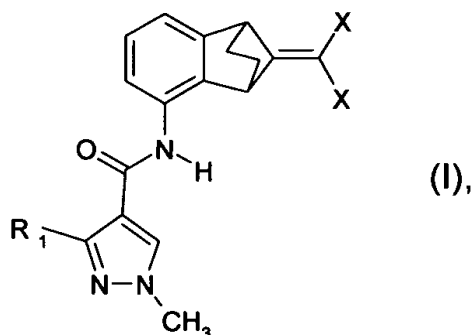
Foreliggende oppfinnelse vedrører nye fungicide preparater egnet for kontroll av sykdommer forårsaket av fytopatogener, spesielt fytopatogene sopper, og en fremgangsmåte for å kontrollere sykdommer på nytteplanter, spesielt rustsopp-sykdommer på soyabønneplanter.

5

Det er kjent fra WO 04/35589 og WO 06/37632 at visse tricykliske aminderivater og blandinger omfattende nevnte aminderivater har biologisk aktivitet mot fytopatogene sopper. På den andre siden er forskjellige fungicide forbindelser fra forskjellige kjemiske klasser vel kjente som plantefungicider for anvendelse på forskjellige avlinger med 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 imidlertid en økning i alvorlige rustsoppinfeksjoner i soyabønneavlinger i Sør-Amerika med den skadelige soppen *Phakopsora pachyhizi* resultert i betydelige utbyttetap. De fleste vanlige fungicider er uegnede for å kontrollere rustsopp i soyabønner, eller deres virkning mot *Phakopsora pachyhizi* er utilfredsstillende.

På bakgrunn av de ovenfor nevnte behovene innen jordbruk for å øke avlingens toleranse og/eller å øke aktiviteten mot fytopatogene sopper foreslås det derfor ifølge foreliggende oppfinnelse en nytt preparat som er egnet for å kontrollere sykdommer forårsaket av fytopatogener omfattende ett preparat egnet for kontroll av sykdommer forårsaket av fytopatogener, omfattende

25 (A) en forbindelse av formel I



hvor R₁ er difluormetyl eller trifluormetyl og X er klor, fluor eller brom; og

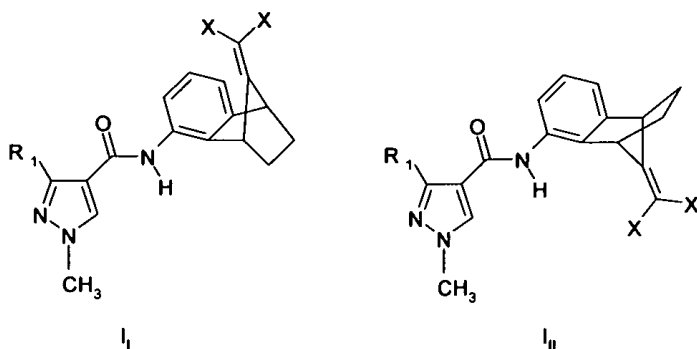
30 (B) fenpropidin.

Det er funnet at anvendelsen av komponent (B) i kombinasjon med komponent (A) uventet og vesentlig forbedrer effektiviteten av sistnevnte mot sopp, og vice versa. I tillegg er fremgangsmåten effektiv mot et bredere spektrum av slike sopper som kan bekjempes med de aktive bestanddelene i henhold til denne fremgangsmåten, når de anvendes alene.

Et ytterligere aspekt ved foreliggende oppfinnelse er en fremgangsmåte for å kontrollere sykdommer forårsaket av fytopatogener på nytteplanter eller på formeringsmateriale for slike, som omfatter å påføre på nytteplanter, voksestedet eller formeringsmateriale for disse ett preparat ifølge oppfinnelsen. Foretrukket er en fremgangsmåte som omfatter å påføre på nytteplantene eller deres voksested ett preparat ifølge oppfinnelsen, mer foretrukket på nytteplantene. Foretrukket er videre en fremgangsmåte som omfatter å påføre på formeringsmaterialet for nytteplantene ett preparat ifølge oppfinnelsen.

15

Forbindelser med formel I opptrer i to forskjellige stereoisomerer, som beskrives som de enkle enantiomerene med formler I_I og I_{II}:



20

Oppfinnelsen dekker alle slike stereoisomerer og blandinger derav i ethvert forhold. Ifølge oppfinnelsen betyr "racemisk forbindelse med formel (I)" en racemisk blanding av forbindelser I_I og I_{II}.

25

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

3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4- karboksylsyre(9-diklormetylidenebenzonorboren-5-yl)amid (forbindelse A-1.1); 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4- karboksylsyre(9-difluormetylidenebenzonorboren-5-yl)amid (forbindelse A-

30

1.2); og 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4- karboksylsyre(9-dibrommetyliden-benzonorboren-5-yl)amid (forbindelse A-1.3).

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

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

10 1-metyl-3-trifluormetyl-1H-pyrazol-4- karboksylsyre(9-diklormetyliden-benzonorboren-5-yl)amid (forbindelse A-1.4);
1-metyl-3-trifluormetyl-1H-pyrazol-4- karboksylsyre(9-difluormetyliden-benzonorboren-5-yl)amid (forbindelse A-1.5); og
1-metyl-3-trifluormetyl-1H-pyrazol-4- karboksylsyre(9-dibrommetyliden-
15 benzonorboren-5-yl)amid (forbindelse A-1.6).

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

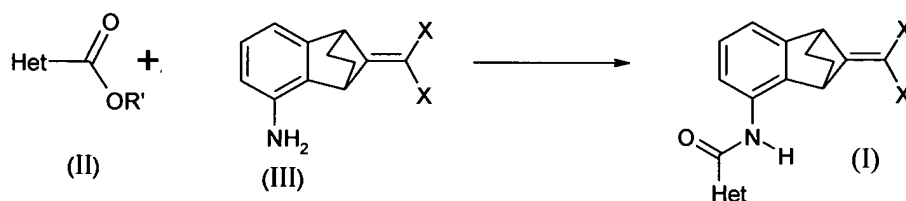
Ytterligere foretrukne preparater ifølge oppfinnelsen omfatter som komponent (A) forbindelsen 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylsyre(9-diklormetyliden-benzonorboren-5-yl)amid (forbindelse A-1.1) og som komponent (B) fenpropidin.

Ytterligere foretrukne preparater ifølge oppfinnelsen omfatter som komponent (A) forbindelsen 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksylsyre(9-difluormetyliden-benzonorboren-5-yl)amid (forbindelse A-1.2) og som komponent (B) fenpropidin.

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

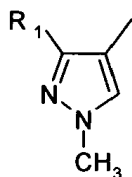
4

Reaksjonsskjema 1



H

et er:

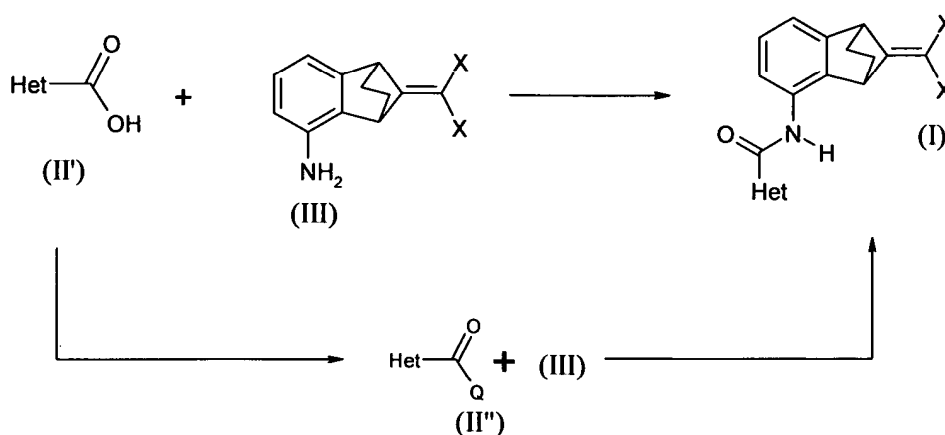


5

Som vist i reaksjonsskjema 1, kan en forbindelse med formel (I), hvor R_1 og X er som definert ovenfor, syntetiseres ved å omsette en forbindelse med formel (II), hvor R_1 er som definert ovenfor og R' er C_{1-5} alkyl, med et anilin med formel (III), hvor X er som definert overfor, 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.*

10

Reaksjonsskjema 2



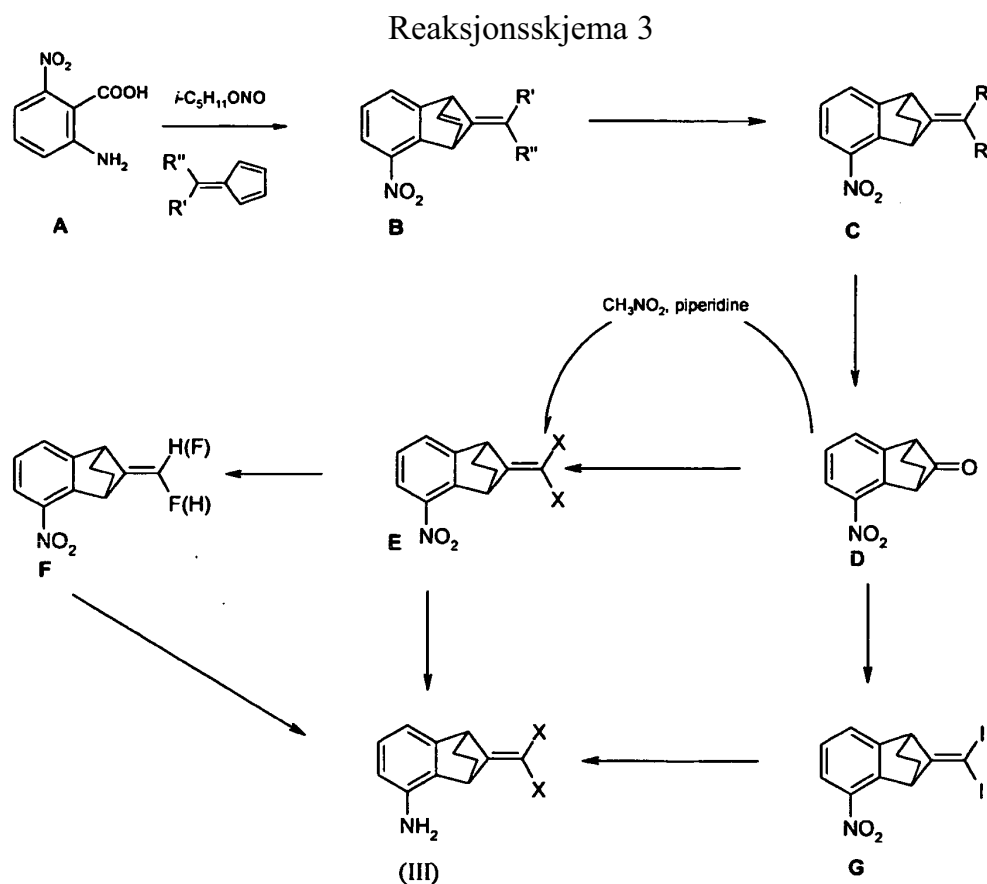
15

Som vist i reaksjonsskjema 2, kan alternativt en forbindelse med formel (I) hvor Het er som definert i reaksjonsskjema 1 og R_1 og X er som definert ovenfor, fremstilles ved å omsette en forbindelse med formel (II') hvor Het er som definert ovenfor, med anilin med formel (III) hvor X er som definert ovenfor, i nærvær av et aktiveringsmiddel, så som BOC-Cl (bis-(2-okso-3-oksazolidinyl)forfinsyre), og to ekvivalenter av base, så som trietylamin, i et oppløsningsmiddel, så som diklormetan (som

20

beskrevet for eksempel av J. Cabre et al, Synthesis **1984**, 413), eller ved å omsette en forbindelse med formel (II') hvor Het er som definert ovenfor og Q er klor, fluor eller brom, med et anilin med formel (III) hvor X er som definert ovenfor, i nærvær av en ekvivalent av en base, så som trietylamin eller natrium- eller kaliumkarbonat eller -bikarbonat, i et oppløsningsmiddel, så som diklormetan, etylacetat eller N,N-dimetylformamid, fortrinnsvis ved -10 til 30°C. Forbindelsen med formel (II'') oppnås fra en forbindelse med formel (II') ved behandling med et halogenerende middel, så som tionylklorid, tionylbromid, oksalyklorid, fosgen, SF₄/HF, DAST ((dietylamino)svoveltrifluorid) i et oppløsningsmiddel, 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 med henvisning til reaksjonsskjema 3.



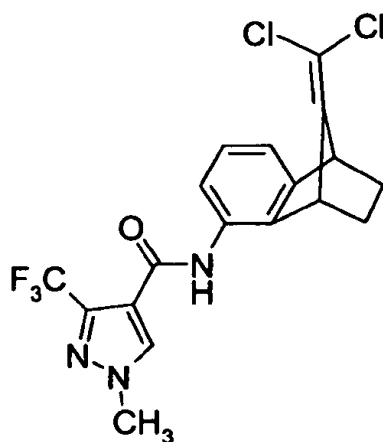
Som vist i reaksjonsskjema 3 kan forbindelsen med formel (III) fremstilles ved en *Bechamp*-reduksjon eller ved andre etablerte fremgangsmåter, for eksempel ved selektiv katalytisk hydrogenering av nitroforbindelsene (E), (F) og (G).

- 5 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 dihalogenmetylidenefosforaner $R'''_3P=C(R^4)R^5$, hvor R''' er trifenyl, tri- C_{1-4} alkyl eller tridimetylamin og X er halogen, i henhold til, eller analogt, med fremgangsmåten beskrevet av H.D.Martin et al, *Chem. Ber.* 118, 2514 (1985), S. Hayashi et al,
10 *Chem. Lett.* 1979, 983 eller M. Suda, *Tetrahedron Letters*, 22, 1421 (1981).

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

EKSEMPEL 1

- 15 Dette eksempelet illustrerer fremstillingen av 1-metyl-3-trifluormetyl-1H-pyrazol-4-karboksylsyre(9-diklormetylidene-benzonorborene-5-yl)amid (forbindelse A-1.4):

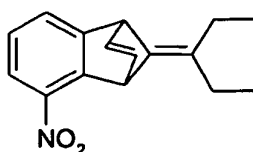


- 20 9-diklormetylene-5-amino-benzonorborene (175 mg, 0.729mmol, fremstilt som beskrevet i eksempel 6) i diklormetan (10ml) ble omsatt med 1-metyl-3-trifluormetyl-1H-pyrazol-karboksylsyre (170mg, 0,874mmol, 1,2 ekv.) i nærvær av bis-(2-okso-3-oksazolidinyl)-fosfinsyreklorid (278mg, 1,09 mmol, 1,5 ekv.) og trietylamin (184mg, 1,821mmol, 2,5 ekv.) ved omgivelsestemperatur under omrøring i 23
25 timer. Reaksjonsblandingen ble ekstrahert med mettet natriumbikarbonatopløsning og mettet saltvannsopløsning, tørket over Na_2SO_4 og renses på silikagel i etylacetat-hexan (1:1). Det ble oppnådd 210 mg (69% av teoretisk) av 1-metyl-3-trifluormetyl-1H-pyrazol-4-karboksylsyre(9-diklormetylidene-benzonorborene-5-yl)amid (forbindelse A-1.4, smp. 179-181°C).

EKSEMPEL 2

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

5

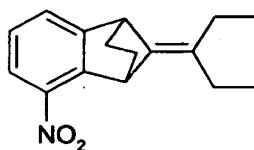


- 10 Til en godt omrørt oppløsning av isopentylnitritt (2,31 ml, 1,3 ekv.) i dimetoksyetan (50 ml) ved 58°C ble en blanding av 6-nitroantranilsyre (2,76 g, 1 ekv.) og 6,6-dietylfulven (6,45 g av 79% renhet, 2,5 ekv.) oppløst i 25 ml dimetoksyetan tilsatt dråpevis i løpet av 8 minutter mens temperaturen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

EKSEMPEL 3

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

20



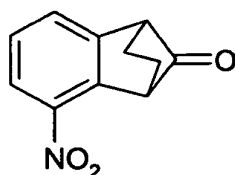
- 9-(3-pentyliden)-5-nitro-benzonorbomadien (7,97 g fremstilt som beskrevet i
- 25 Eksempel 2) i THF (70 ml) ble hydrogenert ved 20°C i nærvær av Rh(PPh₃)₃Cl (Wilkinson's katalysator: 0,8 g). Reaksjonen opphørte etter opptak av en ekvivalent hydrogen. Inndampning og filtrering av råproduktet på silikagel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

30

EKSEMPEL 4

Dette eksemplet illustrerer fremstillingen av 9-okso-5-nitro-benzonorbomen

8

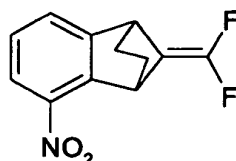


9-(3-pentyliden)-5-nitro-benzonorbornen (7,0 g, 27,2 mmol fremstilt som beskrevet i Eksempel 3) oppløst i diklormetan (300 ml) og metanol (5 ml) ble ozonbehandlet
 5 (2,8 l O₂/min., 100 Watt, tilsvarende 9,7 g O₃/h) ved -70°C inntil en vedvarende blåfarge ble observert (etter ca. 15 minutter). Reaksjonsblandingen 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 oppløsningsmidlet ble resten rensset på silikagel i heksan-EtOAc 3:1 for å gi 5,2 g av forbindelse 36.01
 10 (smp. 112 - 114°C).

EKSEMPEL 5

Dette eksemplet illustrerer fremstillingen av 9-difluormetyliden-5-nitro-benzonorbornen

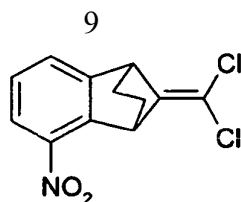
15



Til en oppløsning av dibromdifluormetan (6,30 g, 30 mmol) ved 0°C i THF (50 ml) ble det tilsatt tris-(dimetyl-amino)-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
 20 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 hellt på is-vann og ekstrahert med etylacetat. Rensing på silikagel
 25 i etylacetat-heksan (1:4) ga 4,675 g 9-difluormetyliden-5-nitro-benzonorbornen (smp. 99 - 101°C).

EKSEMPEL 6

Dette eksemplet illustrerer fremstillingen av 9-diklormetyliden-5-nitro-benzonorbornen
 30

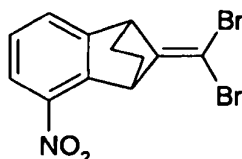


Tørr karbontetraklorid (5,9 g, 33 mmol) ble omsatt med trifenylfosfin (14,46, 55.1 mmol) i diklormetan (30 ml) ved romtemperatur i 1 time. 9-okso-5-nitrobenzonorbornen (5,60 g, 27,56 mmol; fremstilt som beskrevet i Eksempel 4) i diklormetan (10 ml) ble tilsatt dråpevis og omrørt i 20 timer ved romtemperatur. Etter vandig opparbeidelse (is-vann) og ekstraksjon med diklormetan ble råproduktet rensset på silikagel i etylacetat-heksan-(1:4) for å oppnå det ønskede 9-diklormetyliden-5-nitro-benzonorbornen (1,83 g; smp. 136 - 137°C). Noe utgangsmateriale (4,06 g) ble gjenvunnet.

10

EKSEMPEL 7

Dette eksemplet illustrerer fremstillingen av 9-dibrommetyliden-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 (is-vann) og ekstraksjon med diklormetan etterfulgt av kolonnekromatografi (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_3 som oppløsningsmiddel, med mindre annet er angitt, for forbindelser med formel (I). I tabellen er temperaturer gitt i grader Celsius, "NMR" betyr kjernemagnetisk resonansspektrum og følgende forkortelser anvendes:

30

Smp = smeltepunkt
s = singlett
d = dublett

b.p. = kokepunkt
br = bred
dd = dobbeldubletter

10

t = triplett

k = kvartett

m = multiplott

ppm = deler pr. 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), 7,18 (5, 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).

5

Komponenten (B) er kjent og beskrevet i “The Pesticide Manual” [The Pesticide Manual - A World Compendium; 13. utgave; red.: C.D.S. Tomlin; The British Crop Protection Council] under oppslagsnummer (343). Gjennom foreliggende

dokument står uttrykket ”preparat” for de forskjellige blandinger eller kombinasjonene av komponenter (A) og (B) for eksempel i en enkelt ”blandingsklar” form, i en kombinert sprayblanding sammensatt av separate formuleringer av de enkelte aktive bestanddelskomponentene, så som en ”tankblanding”, eller i en kombinert anvendelse av de enkelte aktive bestanddelene når de anvendes på en trinnvis måte, dvs. en etter den andre på relativt kort tid, så som få timer eller dager. Rekkefølgen for påføring av komponentene (A) og (B) er ikke vesentlig for utførelsen av foreliggende oppfinnelse.

- 10 Preparaten ifølge oppfinnelsen er effektiv mot skadelige mikroorganismer, så som mikroorganismer som forårsaker fytopatogene sykdommer, spesielt mot fytopatogene sopp og bakterier.

Preparatene ifølge oppfinnelsen er effektive spesielt mot fysiopatogene sopp tilhørende følgende klasser: Ascomycetes (for eksempel *Venturia*, *Podosphaera*, *Erysiphe*, *Monilinia*, *Mycosphaerella*, *Uncinula*); Basidiomycetes (for eksempel the genus *Hemileia*, *Rhizoctonia*, *Phakopsora*, *Puccinia*, *Ustilago*, *Tilletia*); Fungi imperfecti (også kjent som Deuteromycetes, for eksempel *Botrytis*, *Helminthosporium*, *Rhynchosporium*, *Fusarium*, *Septoria*, *Cerospora*, *Alternaria*, *Pyricularia* og *Pseudocercosporia*); Oomycetes (for eksempel *Phytophthora*, *Peronospora*, *Pseudoperonospora*, *Albugo*, *Bremia*, *Pythium*, *Pseudosclerospora*, *Plasmopara*).

I henhold til oppfinnelsen omfatter ”nytteplanter” typisk følgende plantesorter: 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 rasp, valmue, oliven, solsikke, kokosnøtt, ricinusoljeplanter, 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, tomat, poteter, agurkrot eller paprika; laurbærfamilien, så som avokado, kanel eller kamfer; mais; tobakk; 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.

- 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 av PPO (protoporfyrinogen-oksidas)inhibitorer) som et resultat av konvensjonelle dyrkningsfremgangsmåter eller en teknologi. Et eksempel på en avling som er gjort tolerant overfor imidazolinoner, for eksempel imazamoks, ved konvensjonelle dyrkningsmetoder (mutagenese) er Clearfield® sommerraps (Canola). Eksempler på avlinger som er gjort tolerante overfor herbicider eller klasser av herbicider ved genteknologiske fremgangsmåter, omfatter glyfosat- og glufosinatresistente maisvarianter som er vanlig tilgjengelig under varemerkene RoundupReady®, Herculex I® og LibertyLink®.
- 15 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.
- 20 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 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 fremstilling av slike transgene planter er generelt kjente for fagpersonen og er for eksempel beskrevet i publikasjonene nevnt ovenfor.
- 30 Betegnelsen ”lokasjon” for en nytteplante, som er anvendt heri, er ment å omfatte steder 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.
- 35 Betegnelsen ”planteformeringsmateriale” er underforstått å angi generative deler av planten, så som frø, som siden kan anvendes for formering, og vegetativt materiale, så som avkutt eller knoller, for eksempel poteter. Det kan nevnes for eksempel frø

(i streng forstand), røtter, frukter, rotknoller, jordstengler og deler av planter. Spirende planter og unge planter som skal forflyttes 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

5 ”planteforneringsmaterialet” forstås å betegne frø.

Preparatene ifølge oppfinnelsen kan også anvendes innen feltet beskyttelse av lagringsvarer mot angrep av sopp. I henhold til foreliggende oppfinnelse skal betegnelsen ”lagringsvarer” forstås å betegne naturstoffer av vegetabilsk og/eller

10 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

15 under definisjonen av lagringsvarer er tømmer, enten i form av rått tømmer, 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. Preparatene ifølge foreliggende oppfinnelse kan forebygge uheldige effekter som nedbrytning, misfarging

20 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.

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

30 Preparatene ifølge foreliggende oppfinnelse kan også anvendes innen feltet beskyttelse av et teknisk materiale mot angrep av sopp. I henhold til foreliggende oppfinnelse omfatter betegnelsen ”teknisk materiale” papir, tepper; konstruksjonsmaterialer; kjøle- og oppvarmingssystemer; veggplater; ventilasjon og luftkondisjoneringsystemer og lignende; fortrinnsvis forstås ”teknisk materiale” å

35 betegne veggplater. Preparatene ifølge foreliggende oppfinnelse kan forebygge uheldige effekter så som nedbrytning, misfarging eller mugg.

Preparatene ifølge oppfinnelsen er spesielt effektive mot meldugg; rustsopper; bladflekksyke-species; 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 agurkplanter; *Sclerotinia* i torv, grønnsaker, solsikke og oljefrø raps; svartråte, rødbrann, mjøldugg, gråsopp og ”dead arm”-sykdom i vinranke; *Botrytis cinerea* i frukter; *Monilinia* spp i frukter og *Penicillium* spp i frukter.

Preparatene 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 solani*, *Fusarium subglutinans*, *Gäumannomyces graminis*, *Helminthosporium* spp., *Microdochium nivale*, *Phoma* spp., *Pyrenophora graminea*, *Pyricularia oryzae*, *Rhizoctonia solani*, *Phizoctonia 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; oljefrø raps; poteter; belgfruktavlinger, så som erter, linser eller kikerter; og solsikke.

20

Preparatene ifølge oppfinnelsen er videre spesielt effektive mot etterinnhøstings-sykdommer, 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.

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

Alternaria-species i frukt og grønnsaker; *Ascochyta*-species 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*-species i belgfruktavlinger; *Erysiphe*-species i cerealer; så som *Erysiphe graminis* på hvete og *Erysiphe graminis* på bygg; *Erysiphe cichoracearum* og *sphaerotheca fuliginea* i agurkplanter; *Fusarium*-species i cerealer

35

og mais; *Gäumannomyces graminis* i cerealer og plener; *Helminthosporium-species* i mais, ris og poteter; *Hemileia vastatrix* på kaffe; *Midrodochium-species* i hvete og ryg; *Mycosphaerella fijiensis* i bananer; *Phakopsora-species* i soyabønner, så som *Phakopsora pachyrizi* i soyabønner; *Puccinia-species* i cerealer, bredbladete avlinger og flerårige planter; så som *Puccinia recondita* på hvete, *Puccinia striiformis* på hvete og *Puccinia recondita* på rug; *Pseudocercospora-species* i cerealer, så som *Pseudocercospora herpotrichoides* i hvete; *Phragmidium mucronatum* i roser; *Podosphaera-species* i frukter; *Pyrenophora-species* i bygg; så som *Pyrenophora teres* på bygg, *Pyricularia oryzae* i ris; *Ramularia collo-cygni* i bygg; *Rhizoctonia-species* i bomull, soyabønne, cerealer, mais, poteter, ris og plener, så som *Rhizoctonia solani* på poteter, ris, torv og bomull; *Rhynchosporium secalis* på bygg; *Rhynchosporium secalis* på rug; *Sclerotinia-species* i plener, bladsalat, grønnsaker og oljefrørops, så som *Sclerotinia sclerotiorum* på oljefrørops og *Sclerotinia homeocarpa* på torv; *Septoria-species* i cerealer, soyabønner og grønnsaker, så som *Septoria tritici* på hvete, *Septoria nodorum* på hvete og *Septoria glyciner* på soyabønner; *Sphacelotheca reilliana* i mais; *tilletia-species* i cerealer; *Uncinula necator*, *Guignardia bidwellii* og *Phomopsis viticola* i vinranker; *Urocystis occulta* i rug; *Uromyces-species* i bønner; *ustilago-species* i cerealer og mais; *Venturia-species* i frukter, så som *Venturia inequalis* på epler; *Monilinia-species* på frukter; *Penicillium-species* 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 forbindelse med formel I: forbindelse med formel B-2 er 10:1. Vektforholdet mellom komponent (A) til 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 preparater hvor komponent (A) og komponent (B) er til stede i preparaten i mengder som gir en synergistisk effekt. Denne synergistiske aktiviteten fremgår fra det faktum at den fungicide aktiviteten av preparaten omfattende komponent (A) og komponent (B) er større enn summen av de fungicide aktivitetene for 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 fytopatogen kontroll selv når de to individuelle

komponentene er blitt totalt ineffektive 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, 10 sidene 20 – 22, 1967):

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

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

- Dersom virkningen som reelt observeres (O) er større enn den forventede virkningen (E), er virkningen av kombinasjonen superadditiv, dvs. det foreligger en 20 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 fungicid aktivitet, preparatene ifølge oppfinnelsen også ha ytterligere overraskende fordelaktige egenskaper. Eksempler på slike fordelaktige egenskaper som kan 30 nevnes er: mer fordelaktig nedbrytbarhet; forbedret toksikologisk og/eller øko-toksikologisk 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 kornmodning, mindre plante- 35 ledging, forøket skuddvekst, forbedret plantekraft og tidlig spiring.

Noett preparater ifølge oppfinnelsen har en systemisk virkning og kan anvendes som bladverk, jord- og frøbehandlingsfungicider.

5 Med preparatene 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 delen av planten som gror senere også beskyttes mot angrep ved fytopatogene mikroorganismer.

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

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

20 Mengden av preparaten 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.

25 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).

30 I jordbrukspraksis avhenger påføringsratene av preparatene ifølge oppfinnelsen av typen effekt som ønskes, og varierer typisk fra 20 til 4000 g total preparat pr. hektar.

35 Når preparaten 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 pr. kilo frø, og 0,001 til 50 g av en forbindelse av komponent (B) pr. kilo frø, fortrinnsvis fra 0,01 til 10 g pr. kilo frø, generelt tilstrekkelig.

Preparaten 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 flytbart (OF), et oljeblandbart flytende (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 adjuvaner som er akseptable innen jordbruk.

Slike preparater kan fremstilles på konvensjonell måte, for eksempel ved å blande de aktive bestanddelene med minst en egnet inert formuleringsadjuvan (for eksempel fortynningsmidler, oppløsningsmidler, fyllstoffer og eventuelt andre formuleringsbestanddeler så som surfaktanter, biocider, anti-frysetilsetninger, 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 lignin-sulfonat, et fettalkylsulfat og etoksyliert alkylfenol og et oksyliert fettalkohol.

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

En frøbeisingsformulering påføres på kjent måte på frøene ved anvendelse av preparatene ifølge oppfinnelsen og et fortynningsmiddel i egnet frøbeisingsformuleringsform, 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.

- 5 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 sinerte 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
- 10 lignende. Konsentrerte former av preparater inneholder generelt mellom omtrent 2 og 80%, fortrinnsvis mellom omtrent 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
- 15 fortynnede formuleringer.

Fremgangsmåten ifølge oppfinnelsen tillater også god kontroll av andre farlige sopp som ofte opptrer i soyabønneplanter. De mest viktige soppsykdommene i soyabønner er *Phakopsora pachyrhizi*, *Microsphaera diffusa*, *Cercospora kikuchi*,

20 *Cercospora soja*, *Septoria glycines* og *Colletotrichum truncatum*, hvorav visse omfatter det såkalte "sensesong sykdomskomplekset" og videre *Rhizoctonia solani*, *Corynespora cassicola*, *Sclerotinia sclerotiorum* og *Sclerosium rolfsii*.

Som beskrevet ovenfor for betegnelsen "nytteplante" omfatter betegnelsen

25 "soyabønneplante" alle soyabønneplanter og alle varianter, innbefattende transgene planter. Betegnelsen "soyabønneplante" omfatter spesielt glyfosat tolererbare soyabønneplanter.

Med "glyfosat-tolererbare" menes at plantene for anvendelse i fremgangsmåten er

30 resistente overfor glyfosatpåføring eller tolerante overfor glyfosat. Glyfosat-tolerante planter er gjort tolerante overfor glyfosat ved konvensjonell foredling eller har vært utsatt for en transgen hendelse som tilveiebringer glyfosat resistens. 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;

35 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. 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 5 transgene hendelsene kan også være rettet mot andre pesticid-resistente trekk, så som insekticid, nematicid, fungicid, også videre resistens, som kan oppnås ved konvensjonell dyrking eller ved å innføre en transgen hendelse.

Linjer av transgene glyfosattolererbare avlingsplanter som er overveiende for 10 anvendelse av fremgangsmåten ifølge oppfinnelsen, omfatter for eksempel Roundup Ready®Soybean 40-3-2.

En ”transgen plante” refererer til en plante som inneholder genetisk materiale som ikke finnes (dvs. ”eksogen”) i en villtype-plante av samme species, sort eller 15 kultivar. Det genetiske materialet kan omfatte et transgen, en innskudds-mutagenese-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 20 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 25 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 en plantedel, så som frø, frukt, blad eller rot, plantevev, plantecelle eller et hvilket som helst annet plantemateriale, for eksempel et planteeksplantat, så vel som avkommet derav, og in 30 vitro systemer som etterligner de kjemiske eller cellulære komponenter eller prosesser i en celle.

Eksemplene som følger tjener til å illustrere oppfinnelsen, ”aktive bestanddeler” betegner en blanding av komponent (A) og komponent (B) i et spesifikt blandings- 35 forhold.

Formuleringseksempler

<u>Fuktbare pulvere</u>		a)	b)
	Aktiv bestanddel [A]:B) = 1:3(a), 1:1(b)]	25%	75%
	Natriumlignosulfonat	5%	-
5	Natriumlaurylsulfat	3%	5%
	Natriumdiisobutylnaftalensulfonat (7-8 mol etylenoksid)	-	10%
	Høydispergert kiselsyre	5%	10%
	Kaolin	62%	-

10

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.

<u>Pulvere for tørrfrøbehandling</u>		a)	b)
	Aktiv bestanddel [A] : B) = 1:3(a), 1:1(b)]	25%	75%
	Lett mineralolje	5%	5%
	Høydispergert kiselsyre	5%	-
	Kaolin	65%	-
20	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.

25

<u>Emulgerbart konsentrat</u>		
	Aktiv bestanddel (A) : B) = 1:6)	10%
	Oktylfenolpolyetylglykoleter (4 – 5 mol etylenoksid)	3%
30	Kalsiumdodecylbensensulfonat	3%
	Ricinusolje polyglykoleter (35 mol etylenoksid)	4%
	Cykloheksanan	30%
	Xylenblanding	50%

35 Emulsjoner av den påkrevde fortynning, som kan anvendes ved plantebeskyttelse, kan oppnås fra dette konsentratet ved fortynningen av vann.

22

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

5

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.

<u>Ekstruderte granuler</u>	<u>% vekt/vekt</u>
Aktiv bestanddel (A) : B) = 2:1)	15%
Natriumlignosulfonat	2%
Natriumalkylnaftalensulfonat	1%
Kaolin	82%

15

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

<u>Suspensjonskonsentrat</u>	
Aktiv bestanddel (A) : B) = 1:8)	40%
Propylenglykol	10%
Nonylfenol polyetylen glykoleter (15 mol etylenoksid)	6%
Natriumlignosulfonat	10%
25 Karboksymetylcellulose	1%
Silikonolje (i form av en 75% emulsjon i vann)	1%
Vann	32%

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

<u>Flytbart konsentrat for frøbehandling</u>	
Aktiv bestanddel (A) : B) = 1:8)	40%
Propylenglykol	5%

35

	Kopolymer butanol PO/EO	2%
	Tristyrenfenoletoksylylat (med 10 – 20 mol EO)	2%
	1,2-benzisotiazolin-3-on	0,5%
	Monoazo-pigment kalsiumsalt	5%
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 fortynninger kan formeringsmaterialet behandles og beskyttes mot angrep av mikroorganismer ved spraying, helling eller neddykking.

Biologiske eksempler

15

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

Sporer av soppen fra kryogent lager blandes direkte i næringsoppløsning (PDB potetdekstroseoppløsning). Etter plassering av en (DMSO) oppløsning av forsøksforbindelsene i en mikrotiterplate (96-brønns format) tilsettes næringsoppløsningen inneholdende sporene. Forsøksplatene inkuberes ved 24°C og vekstinhiberingen evalueres etter 4 dager. Den ventede fungicide virkningen beregnes i henhold til Colby-metoden. Resultatene er angitt i Tabeller B1:

20

Tabell B1: Fungicid virkning mot *Botrytis cinerea*:

25

Tabell B1.1:

Forbindelse A-1.2	Fenpropidin		
ppm	ppm	% aktivitet	
2,0000		70	
1,0000		50	
0,5000		20	
	2,0000	0	
	1,0000	0	

24

	0,5000	0	Ventet virkning (Colby)
2,0000	2,0000	100	70
1,0000	2,0000	70	50
0,5000	2,0000	50	20
0,5000	1,0000	50	20
0,5000	0,5000	50	20

Eksempel B2: Fungicidvirkning mot *Alternaria solani* (tørrflekksyke, tomat/potet):

Konidier av soppen fra kryogen lagring blandes direkte inn i næringsbuljong (PDB
5 potetdekstrose-buljong). Etter å ha plassert en (DMSO) løsning av forsøks-
forbindelser i en mikrotiterplate (96-brønnformat) tilsettes næringsbuljongen som
inneholder soppsporene. Forsøksplatene inkuberes ved 24°C og veksthemmingen
vurderes etter 3 dager. Den forventede soppdrepende virkning beregnes i henhold til
Colby-metoden. Resultatene er oppgitt i tabellene B2:

10

Tabellene B2: Soppdrepende virkning mot *Alternaria solani*:

Tabell B2.1

Forbindelse A- 1.1	Fenpropidin		
ppm	ppm	% aktivitet	
0,2500		50	
0,1250		50	
0,0313		20	
	1,0000	0	
	0,5000	0	
	0,2500	0	
	0,1250	0	Ventet virkning (Colby)

0,2500	1,0000	70	50
0,2500	0,5000	70	50
0,2500	0,2500	70	50
0,1250	0,5000	70	50
0,0313	0,1250	50	20

Eksempel B3: Soppdrepende virking mot *Pseudocercospora herpotrichoide* (syn *Taperis yallundae*), stråknækker på kornsorter:

5 Sporer av soppen fra kryogen 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 B3:

10

Tabellene B3: Soppdrepende virking mot *Pseudocercospora herpotrichoide*

Tabell B3.1

Forbindelse A-1.1	Fenpropidin		
ppm	ppm	% aktivitet	
0,0625		70	
0,0313		50	
0,0156		20	
	0,2500	0	
	0,1250	0	
	0,0625	0	
	0,0313	0	
	0,0156	0	Ventet virkning (Colby)

0,0625	0,2500	90	70
0,0625	0,1250	90	70
0,0625	0,0625	90	70
0,0625	0,0313	90	70
0,0625	0,0156	90	70
0,0313	0,0156	70	50
0,0156	0,0625	50	20
0,0156	0,0313	50	20

Eksempel B4: Fungicid virkning mot *Pyrenophora teres* (Nettflekk)

Sporer av soppen fra kryogent lager 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 4 dager. Den ventede fungicide virkningen beregnes i henhold til Colby-metoden. Resultatene er gitt i Tabeller B4:

10 Tabell B4: Fungicid virkning mot *Pyrenophora teres*:

Tabell B4.1:

Forbindelse A-1.2	Fenpropidin		
ppm	ppm	% aktivitet	
2,0000		70	
0,1250		20	
	2,0000	0	
	0,5000	0	
	0,2500	0	
	0,1250	0	
	0,0625	0	Ventet virkning

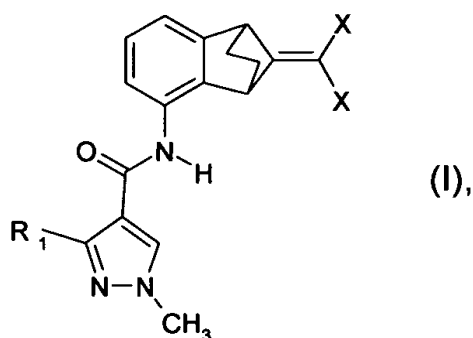
27

			(Colby)
2,0000	2,0000	90	70
0,1250	0,5000	50	20
0,1250	0,2500	50	20
0,1250	0,1250	50	20
0,1250	0,0625	50	20

Patentkrav

1. Preparat egnet for kontroll av sykdommer forårsaket av fytopatogener, omfattende

5 (A) en forbindelse med formel I



hvor R_1 er difluormetyl eller trifluormetyl og X er klor, fluor eller brom; og

10 (B) forbindelsen fenpropidin.

2. Preparat ifølge krav 1, hvor komponent (A) er en forbindelse med formel (I), hvor R_1 er difluormetyl.

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

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

20

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

6. Ett preparat ifølge krav 1, som omfatter som komponent (A) en forbindelse
 25 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)
 fenpropidin.

7. Ett preparat ifølge krav 1, som omfatter som komponent (A) forbindelse 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksytsyre (9-diklormetylidbenzonorboren-5-yl)amid, og som komponent (B) fenpropidin.
- 5 8. Ett preparat ifølge krav 1, som omfatter som komponent (A) forbindelse 3-difluormetyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-karboksytsyre (9-difluormetylidbenzonorboren-5-yl)amid, og som komponent (B) fenpropidin.
9. Preparat ifølge krav 1, hvor vektforholdet mellom (A) og (B) er fra 2000:1 til
10 1:1000.
10. Fremgangsmåte for å kontrollere sykdommer forårsaket av fytopatogener på nytteplanter eller på formeringsmaterialer for disse, omfattende å påføre på nytteplantene, på grostedet for disse eller formeringsmaterialet for disse, ett preparat
15 ifølge krav 1.
11. Fremgangsmåte for å kontrollere sykdommer på soyabønneplanter forårsaket av fytopatogener, omfattende å påføre på soyabønneplantene eller deres voksested, ett preparat ifølge krav 1.
- 20 12. Fremgangsmåte ifølge krav 11, hvor fytopatogenet er *Phakopsora pachyrhizi*.