

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(11) **036537**

(13) **B1**

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ

- | | |
|--|---|
| <p>(45) Дата публикации и выдачи патента
2020.11.20</p> <p>(21) Номер заявки
201892678</p> <p>(22) Дата подачи заявки
2015.06.15</p> | <p>(51) Int. Cl. <i>A01N 43/653</i> (2006.01)
<i>A01N 43/80</i> (2006.01)
<i>A01N 47/40</i> (2006.01)
<i>A01N 47/22</i> (2006.01)
<i>A01N 53/00</i> (2006.01)
<i>A01N 47/24</i> (2006.01)
<i>A01N 43/90</i> (2006.01)
<i>A01N 25/00</i> (2006.01)
<i>A01P 3/00</i> (2006.01)</p> |
|--|---|

(54) ПЕСТИЦИДНЫЕ КОМПОЗИЦИИ

- | | |
|---|--|
| <p>(31) 14173980.5</p> <p>(32) 2014.06.25</p> <p>(33) EP</p> <p>(43) 2019.04.30</p> <p>(62) 201790064; 2015.06.15</p> <p>(71)(73) Заявитель и патентовладелец:
БАСФ АГРО Б.В. (NL)</p> <p>(72) Изобретатель:
Менгес Фредерик, Земар Мартин,
Брам Лутц, Шустер Аннетте (DE),
Мацуир Флорент (US)</p> <p>(74) Представитель:
Веселицкий М.Б., Веселицкая И.А.,
Кузенкова Н.В., Каксис Р.А., Белоусов
Ю.В., Куликов А.В., Кузнецова Е.В.,
Соколов Р.А., Кузнецова Т.В. (RU)</p> | <p>(56) EP-A2-0354183
US-A-4940720
US-A1-2014127322
US-A1-2010240619
WO-A1-2013024083
WO-A1-2013024080
WO-A1-2013007767
EP-A2-0126430</p> |
|---|--|

(57) Изобретение относится к пестицидным композициям, содержащим соединение I-3, а именно 2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол, в качестве компонента I и соединение II-7 трифлумезопирим (мезоионный) в качестве компонента II, и к их применению для борьбы с фитопатогенными грибами, а также к защите материала для размножения растений от поражения фитопатогенными грибами.

B1

036537

036537 B1

Изобретение относится к пестицидной композиции, которая содержит:

1) в качестве компонента I соединение I-3 2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол и

2) в качестве компонента II трифлумезопирим (мезоионный) (II-7).

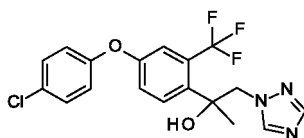
Кроме того, изобретение относится к применению композиций согласно изобретению в качестве пестицидов, в частности, для борьбы с фитопатогенными грибами, как указано в данном описании, и препаратам или композициям, содержащим их. Кроме того, изобретение также относится к семенам, содержащим композиции. Кроме того, изобретение относится также к способам борьбы с вредителями, в частности фитопатогенными грибами, как указано в данном описании, в которых грибки или материалы, растения, почву или семена, которые необходимо защитить от поражения грибами, обрабатывают эффективным количеством композиций в соответствии с изобретением.

С целью снижения норм применения и расширения спектра активности известных соединений задачей настоящего изобретения было создание композиций, которые при пониженном применяемом общем количестве активных соединений показывают улучшенную активность против важных вредителей, в частности фитопатогенных грибков, в частности для определенных показаний. Еще одной задачей было обеспечение композиций, которые полезны для контроля конкретных патогенов в конкретных важных культурах, которые часто подвержены нападению патогенов.

Соответственно, мы нашли композиции и виды применения, определенные в начале и в последующем описании.

Соединения I (компонент I) могут быть получены различными путями по аналогии с методиками известного уровня техники (см. J. Agric. Food Chem. (2009) 57, 4854-4860; EP 0275955 A1; DE 4003180 A1; EP 0113640 A2; EP 0126430 A2). Кроме того, соединения I (компонент I), их получение и применение в защите культур описаны в WO 2013/007767 (PCT/EP 2012/063626), WO 2013/024076 (PCT/EP 2012/065835), WO 2013/024075 (PCT/EP 2012/065834), WO 2013/024077 (PCT/EP 2012/065836), WO 2013/024081 (PCT/EP 2012/065848), WO 2013/024080 (PCT/EP 2012/065847), WO 2013/024083 (PCT/EP 2012/065852) WO 2013/010862 (PCT/EP 2012/063526), WO 2013/010894 (PCT/EP 2012/063635), WO 2013/010885 (PCT/EP 2012/063620), WO 2013/024082 (PCT/EP 2012/065850), которые также раскрывают определенные композиции с другими активными соединениями. Вследствие основного характера содержащихся в них атомов азота компонент I, т.е. в частности соединение I-3, способно к образованию солей или аддуктов с неорганическими или органическими кислотами или с ионами металлов, в частности солей с неорганическими кислотами.

Соединение I-3 представляет собой 2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол



Примерами неорганических кислот являются галогеноводородные кислоты, такие как фтористый водород, хлористый водород, йодистый водород и бромистый водород, угольная кислота, серная кислота, фосфорная кислота и азотная кислота.

Пригодными органическими кислотами являются, например, муравьиная кислота и алкановые кислоты, такие как уксусная кислота, трифторуксусная кислота, трихлоруксусная кислота и пропионовая кислота, а также гликолевая кислота, тиоциановая кислота, молочная кислота, янтарная кислота, лимонная кислота и бензойная кислота и другие арилкарбоновые кислоты, коричная кислота, щавелевая кислота, алкилсульфоновые кислоты (сульфокислоты с линейными или разветвленными алкильными радикалами от 1 до 20 атомами углерода), арилсульфокислоты или арилдисульфоновые кислоты (ароматические радикалы, такие как фенил и нафтил, которые несут одну или две сульфокислотные группы), алкилфосфоновые кислоты (фосфоновые кислоты с неразветвленными или разветвленными алкильными радикалами с 1 до 20 атомами углерода), арилфосфоновые кислоты или арилдифосфоновые кислоты (ароматические радикалы, такие как фенил и нафтил, которые несут один или два радикала фосфорной кислоты), где алкильные или арильные радикалы могут нести дополнительные заместители, например, *p*-толуолсульфоновая кислота, салициловая кислота, *p*-аминосалициловая кислота, 2-феноксибензойная кислота, 2-ацетоксибензойная кислота и т.д. Пригодными ионами металлов являются, в частности, ионы элементов второй главной группы, в частности кальция и магния, третьей и четвертой главных групп, в частности алюминия, олова и свинца, и также элементов переходных групп от одного до восьми, в частности хрома, марганца, железа, кобальта, никеля, меди, цинка, и другие. Особое предпочтение отдается ионам металлов элементов переходных групп четвертого периода. Металлы могут присутствовать в различных валентностях, которые могут быть предполагаемы.

Компонент I содержит хиральные центры, и они, как правило, получены в виде рацематов. R- и S-энантиомеры соединений в соответствии с изобретением могут быть разделены и выделены в чистом

виде с помощью методов, известных специалисту в данной области, например, с помощью хиральной ВЭЖХ. Пригодными для использования в качестве антимикробных агентов являются как энантиомеры, так и их композиции. Это относится соответственно к композициям. Кроме того, компонент I может присутствовать в различных кристаллических модификациях, которые могут отличаться по биологической активности.

В частности, в каждом случае присутствует рацемическая композиция. Кроме того, любые другие пропорции (R)-энантиомера и (S)-энантиомера могут присутствовать в соответствии с настоящим изобретением. Это относится и к каждой композиции, которая указана в данном описании.

В соответствии с одним вариантом осуществления настоящего изобретения компонент I представляет собой соединение I-3. Соединение I-3 может присутствовать в качестве рацемической композиции (R)-энантиомера и (S)-энантиомера, но (R)-энантиомер и (S)-энантиомер могут также присутствовать в любой другой пропорции, например чистый энантиомер (R) или чистый энантиомер (S) I-3.

В соответствии с одним конкретным вариантом осуществления соединения I-3 обеспечивают и используют в качестве (R)-энантиомера с энантиомерным избытком (е.е.) по меньшей мере 40%, например по меньшей мере 50, 60, 70 или 80%, предпочтительно по меньшей мере 90%, более предпочтительно по меньшей мере 95%, еще более предпочтительно по меньшей мере 98% и наиболее предпочтительно по меньшей мере 99%.

В соответствии с дополнительным конкретным вариантом осуществления соединения I-3 обеспечивают и используют в качестве (S)-энантиомера с энантиомерным избытком (е.е.) по меньшей мере 40%, например по меньшей мере 50, 60, 70 или 80%, предпочтительно по меньшей мере 90%, более предпочтительно по меньшей мере 95%, еще более предпочтительно по меньшей мере 98% и наиболее предпочтительно по меньшей мере 99%.

Соединение (R)-I-3 представляет собой (R)-2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол; соединение (S)-I-3 представляет собой (S)-2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол.

Получение компонента II и его действие против вредных грибов известны (см. <http://www.alanwood.net/pesticides/>), и они, как правило, коммерчески доступны. Коммерчески доступные активные соединения можно найти, например, в The Pesticide Manual, 14th Edition, British Crop Protection Council (2006) и других публикациях.

Так, трифлумезопирим (мезоионный) (II-7) представляет собой 3,4-дигидро-2,4-диоксо-1-(пиримидин-5-илметил)-3-(α,α,α -трифтор-*m*-толил)-2H-пиридо[1,2-а]пиримидин-1-иум-3-ид.

В нижеследующем дополнительно описаны композиции согласно изобретению и их предпочтительные применения. В каждом конкретном случае в соответствии с настоящим изобретением применение композиции для борьбы с конкретным вредителем, в частности фитопатогенным грибом, также предназначено для охвата соответствующего способа борьбы с конкретным вредителем, в частности фитопатогенными грибами, где грибки или материалы, растения, почва или семена, которые должны быть защищены от поражения обрабатывают эффективным количеством композиции, как определено в настоящем описании.

В соответствии с конкретным вариантом осуществления настоящего изобретения, только два активных соединения, как определено, присутствуют в композициях согласно изобретению (далее также называемые "бинарные композиции"). Композиция может, конечно, содержать любые добавки или подобное, как указано ниже, для того, чтобы обеспечить состав, подходящий для применения в сельском хозяйстве.

Массовое соотношение компонента I к компоненту II зависит от свойств используемых активных веществ и обычно находится в диапазоне от 1:1000 до 1000:1, более конкретно 1:500-500:1. Массовое соотношение компонента I к компоненту II может предпочтительно быть в диапазоне от 1:100 до 100:1, часто в диапазоне от 1:50 до 50:1, предпочтительно в диапазоне от 1:20 до 20:1, в особенности предпочтительно в диапазоне от 1:10 до 10:1, в частности в диапазоне от 1:3 до 3:1. Также массовое соотношение предпочтительно может быть в диапазоне от 1:2 до 2:1.

В соответствии с другими вариантами осуществления двухкомпонентных композиций в соответствии с изобретением массовое соотношение компонента I к компоненту II обычно находится в диапазоне от 1:1 до 1:100, регулярно в диапазоне от 1:1 до 1:50, предпочтительно в диапазоне от 1:1 до 1:20, более предпочтительно в диапазоне от 1:1 до 1:10, даже более предпочтительно в диапазоне от 1:1 до 1:4 и, в частности, в диапазоне от 1:1 до 1:2.

В соответствии с одним вариантом осуществления двухкомпонентные композиции в соответствии с изобретением могут предпочтительно иметь массовое соотношение соединения I и соединения II в диапазоне от 1000:1 до 1:1, часто в диапазоне от 100:1 до 1:1, регулярно в диапазоне от 50:1 до 1:1, предпочтительно в диапазоне от 20:1 до 1:1, более предпочтительно в диапазоне от 10:1 до 1:1, даже более предпочтительно в диапазоне от 4:1 до 1:1 и, в частности, в диапазоне от 2:1 до 1:1.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 100:1 до 1:100.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой

массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 1:100 до 100:1.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 1:50 до 50:1.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 1:20 до 20:1.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 1:10 до 10:1.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 1:3 до 3:1.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 1:2 до 2:1.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 1000:1 до 1:1.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 100:1 до 1:1.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 50:1 до 1:1.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 20:1 до 1:1.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 10:1 до 1:1.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 4:1 до 1:1.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 2:1 до 1:1.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 1:1 до 1:1000.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 1:1 до 1:100.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 1:1 до 1:50.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 1:1 до 1:20.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 1:1 до 1:10.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 1:1 до 1:4.

Один дополнительный вариант осуществления изобретения относится к композиции, в которой массовое соотношение компонента I к компоненту II составляет от 1:1 до 1:2.

Как подробно описано выше, компонент I содержит центры хиральности и, следовательно, может присутствовать в виде рацемических смесей, в виде чистых энантиомеров или в двух энантиомерах одного компонента I могут присутствовать в любом соотношении (S):(R).

В соответствии с конкретными вариантами осуществления изобретения соответствующий компонент I присутствует в виде (S) энантиомера. В соответствии с конкретными вариантами осуществления изобретения соответствующий компонент I присутствует в виде (R) энантиомера. В соответствии с одним конкретным аспектом это бинарные композиции, каждая из которых содержит только эти два компонента в качестве активных соединений.

Композиции согласно настоящему изобретению пригодны в качестве фунгицидов. Они отличаются выдающейся эффективностью против широкого спектра фитопатогенных грибов, в том числе почвенных грибов, которые происходят в особенности из классов плазмодиофоромицетов, пероноспоромицетов (син. оомицеты), хитридиомицетов, зигомицетов, аскомицетов, базидиомицетов и дейтеромицетов (син. *Fungi imperfecti*). Некоторые из них являются системно эффективными, и они могут быть использованы в качестве средств защиты растений в качестве листовых фунгицидов, фунгицидов для протравливания семян и почвенных фунгицидов. Кроме того, они пригодны для борьбы с патогенными грибами, которые встречаются, среди прочего, в древесине или корнях растений.

Композиции согласно изобретению особенно важны в борьбе с множеством фитопатогенных грибов на различных культурных растениях, таких как зерновые культуры, например пшеница, рожь, ячмень, тритикале, овес или рис; свекла, например сахарная свекла или кормовая свекла; фрукты, такие как семечковые, косточковые или мягкие, фрукты, например яблоки, груши, сливы, персики, миндаль, вишня, клубника, малина, ежевика или крыжовник; бобовые растения, такие как чечевица, горох, люцерна, или соевые бобы; масляные растения, такие как рапс, горчица, олива, подсолнух, кокос, какао-бобы, растение касторового масла, масличные пальмы, земляные орехи или соевые бобы; бахчевые, такие как

кабачки, огурцы или дыни; волокнистые растения, такие как хлопчатник, лен, конопля или джут; цитрусовые, такие как апельсины, лимоны, грейпфруты или мандарины; овощи, такие как шпинат, салат, спаржа, капуста, морковь, лук, томат, картофель, тыква или паприка; жировые растения, такие как авокадо, корица или камфор; энергетические и сырые растения, такие как кукуруза, рапс, соя, сахарный тростник или пальмовое масло; кукуруза; табак; орехи; кофе; чай; бананы; виноградные лозы (столовый виноград и для виноградного сока); хмель; газон; природные или декоративные фикусы и лесные растения, такие как цветы, кустарники, широколиственные деревья или вечнозеленые, например хвойные; и на материал для размножения растений, такой как семена, и культурный материал этих растений.

Предпочтительно композиции согласно изобретению используются для борьбы со множеством грибков на полевых культурах, таких как картофель, сахарная свекла, табак, пшеница, рожь, ячмень, овес, рис, кукуруза, хлопчатник, соевые бобы, рапс, бобовые, подсолнечник, кофе или сахарный тростник; фрукты; виноградные лозы; декоративные растения; или овощи, такие как огурцы, томаты, бобы или кабачки.

Термин "материал для размножения растений" следует понимать, как означающий все генеративные части растения, такие как семена и вегетативный растительный материал, такой как черенки и клубни (например, картофель), которые могут быть использованы для размножения растения. Это включает в себя семена, корни, плоды, клубни, луковицы, корневища, побеги, ростки и другие части растений, саженцы и в том числе молодые растения, которые необходимо пересадить после прорастания или после появления из почвы. Эти молодые растения также можно защитить до пересадки путем общей или частичной обработки погружением или заливкой.

Предпочтительно обработка материалов для размножения растений с помощью комбинации пестицида I и пестицида II и их композиций согласно изобретению, соответственно, используется для борьбы со множеством грибков на зерновых культурах, таких как пшеница, рожь, ячмень и овес; рис, кукуруза, хлопчатник и соевые бобы.

Термин "культуримуемые растения" также следует понимать, как включающий растения, которые были модифицированы с помощью селекции, мутагенеза или генетической инженерии, включая, но не ограничиваясь ими, сельскохозяйственные биотехнические продукты, которые присутствуют на рынке или находятся в разработке (см. <http://cega-gmc.org/>, см. здесь базу данных ГМ-растений). Генетически модифицированные растения представляют собой растения, генетический материал которых был, таким образом, модифицирован посредством применения методов рекомбинантной ДНК, что в природных условиях не может быть быстро получено с помощью кроссбридинга, мутаций или природной рекомбинации. Типично, один или несколько генов интегрируются в генетический материал генетически модифицируемого растения для того, чтобы улучшить определенные свойства растения. Такие генетические модификации также включают, но не ограничиваются ими, целевые посттрансляционные модификации белка(ов), олиго- или полипептидов, например, с помощью гликозилирования или присоединений полимеров, таких как пренилированные, ацетилированные или фарнезилированные фрагменты или ПЭГ фрагменты.

Растения, которые были модифицированы путем селекции, мутагенеза или генетической инженерии, например, были устойчивыми к оказываемым применениям конкретных классов гербицидов, такие как ингибиторы гидроксифенипируват диоксигеназы (HPPD); ингибиторы ацетолактатсинтазы (ALS), такие как сульфонилмочевины, (см., например, US 6222100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/02526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073) или имидазолиноны (см., например, US 6222100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/002526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/014357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073); ингибиторы (энолпирувиллицимат-3-фосфат-синтазы EPSPS), такие как глифосат (см., например, WO 92/00377); ингибиторы глутаминсинтазы (GS), такие как глюфосинат (см., например, EP 242236 A, EP 242246 A) или оксиниловые гербициды (см., например, US 5559024) в результате обычных методик селекции или геной инженерии. Нескольким культуримуемым растениям была придана стойкость к гербицидам обычными методами селекции (мутагенез), например Clearfield® летний рапс (Canola, BASF SE, Германия) будучи устойчивым к имидазолинонам, например имазамоксу. Генетические инженерные методы были использованы для улучшения культурных растений, таких как соя, хлопок, кукуруза, свекла и рапс, толерантности к гербицидам, таких как глифосат и глюфосинат, некоторые из которых являются коммерчески доступными под торговыми названиями RoundupReady® (глифосат-толерантный, Monsanto, США) и LibertyLink® (глюфосинат-толерантный, Bayer CropScience, Германия).

Кроме того, также включены растения, которые благодаря использованию технологий рекомбинантной ДНК способны синтезировать один или несколько инсектицидных белков, которые главным образом известны из рода бактерий *Bacillus*, особенно из *Bacillus thuringiensis*, таких как 5-эндотоксины, например CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) или Cry9c; растительные инсектицидные белки (VIP), например VIP1, VIP2, VIP3 или VIP3A; инсектицидные белки колонизированных бактериями нематод, например видами *Photorhabdus* или видами *Xenorhabdus*; токсины, проду-

цируемые животными, такие как токсины скорпиона, токсины паукообразного насекомого, токсины осы, или другие специфичные для насекомых нейротоксины; токсины, продуцируемые грибами, такие как токсины стрептомицетов, растительные лектины, такие как лектины гороха или ячменя; агглютинины; ингибиторы протеиназы, такие как ингибиторы трипсина, ингибиторы серинпротеазы, ингибиторы патаина, цистатина или папаина; рибосом-инактивирующие белки (РИБ), такие как ризин, РИБ маиса, абрин, луффин, сапорин или бриодин; ферменты метаболизма стероидов, такие как 3-гидроксистероид-оксидаза, экидстероид-IDP-гликозил-трансфераза, холестериноксидаза, ингибиторы экидизона или ГМГ-КоА-редуктаза; блокаторы ионных каналов, такие как блокаторы натриевых или кальциевых каналов; эстераза ювенильного гормона; рецепторы диуретического гормона (геликокининовые рецепторы); стильбенсинтаза, бибензилсинтаза, хитиназа и глюканаза. В контексте настоящего изобретения эти инсектицидные белки или токсины следует явно понимать также как претоксины, гибридные белки, укороченные или иным образом модифицированные белки. Гибридные белки отличаются новой комбинацией доменов белков, (см., например, WO 02/015701). Дальнейшие примеры таких токсинов или генетически модифицированных растений, способных синтезировать такие токсины, раскрыты, например, в EP 374753 A, WO 93/007278, WO 95/34656, EP 427529 A, EP 451878 A, WO 03/18810 и WO 03/52073. Способы получения таких генетически модифицированных растений в целом известны специалисту в данной области техники и описаны, например, в указанных выше публикациях. Эти инсектицидные белки, содержащиеся в генетически модифицированных растениях, придают растениям, вырабатывающим эти белки, устойчивость к вредителям из всех таксономических групп атроподов, в частности к жукам (Coleoptera), двукрылым насекомым (Diptera) и бабочкам (Lepidoptera), а также к нематодам (Nematoda). Генетически модифицированные растения, способные синтезировать один или несколько инсектицидных белков, описаны, например, в указанных выше публикациях, и некоторые из них доступны для приобретения, например YieldGard® (культивары кукурузы, вырабатывающие токсин CryIAb), YieldGard® Plus (культивары кукурузы, вырабатывающие токсины CryIAb и Cry3Bb1), Starlink® (культивары кукурузы, вырабатывающие токсин Cry9c), Herculex® RW (культивары кукурузы, вырабатывающие Cry34Ab1, Cry35Ab1 и фермент фосфинотрицин-N-ацетилтрансферазы [PAT]); NuCOTN® 33B (культивары хлопчатника, вырабатывающие токсин CryIAc), Bollgard® I (культивары хлопчатника, вырабатывающие токсин CryIAc), Bollgard® II (культивары хлопчатника, вырабатывающие токсины CryIAc и Cry2Ab2); VIPCOT® (культивары хлопчатника, вырабатывающие VIP-токсин); NewLeaf® (культивары картофеля, вырабатывающие токсин Cry3A); Bt-Xtra®, NatureGard®, KnockOut®, BiteGard®, Protecta®, Bt11 (например, Agrisure® CB) и Bt176 от фирмы Syngenta Seeds SAS, Франция (культивары кукурузы, вырабатывающие токсин CryIAb и фермент PAT), MIR604 от фирмы Syngenta Seeds, Франция (культивары кукурузы, вырабатывающие модифицированную версию токсина Cry3A, см. WO 03/018810), MON 863 от фирмы Monsanto Europe S.A., Бельгия (культивары кукурузы, вырабатывающие токсин Cry3Bb1), IPC 531 от фирмы Monsanto Europe S.A., Бельгия (культивары хлопчатника, вырабатывающие модифицированную версию токсина CryIAc) и 1507 от фирмы Pioneer Overseas Corporation, Бельгия (культивары кукурузы, вырабатывающие токсин CryIF и фермент PAT).

Кроме того, также включены растения, которые благодаря использованию технологий рекомбинантной ДНК способны синтезировать один или несколько белков, которые повышают устойчивость или переносимость таких растений в отношении бактериальных, вирусных или грибковых патогенных организмов. Примерами подобных белков являются так называемые "патогенез-связанные белки" (PR белки, см., например, EP 392225 A), гены устойчивости к заболеваниям растений (например, культувары картофеля, которые экспрессируют гены устойчивости, действующие против возбудителей *Phytophthora*, выведенные из дикого мексиканского картофеля *Solanum bulbocastanum*) или T4-лизозим (например, культувары картофеля, которые способны синтезировать эти белки с повышенной устойчивостью к бактериям, таким как *Erwinia amylovora*). Способы получения таких генетически модифицированных растений в целом известны специалисту в данной области и описаны, например, в указанных выше публикациях.

Кроме того, также включены растения, которые благодаря использованию технологий рекомбинантной ДНК, способны синтезировать один или несколько белков, которые повышают продуктивность (например, выработку биомассы, урожай зерна, содержания крахмала, масла или белка), переносимость засухи, засоленности или других ограничивающих рост факторов окружающей среды или переносимость в отношении вредителей и грибковых, бактериальных или вирусных патогенных организмов указанных растений.

Кроме того, также включены растения, которые благодаря использованию технологий рекомбинантной ДНК содержат модифицированное количество содержащихся веществ или новых веществ, в особенности для улучшения питания людей и животных, например масличные культуры, которые вырабатывают полезные для здоровья длинноцепочечные омега-3-жирные кислоты или ненасыщенные омега-9-жирные кислоты (например, рапс Nexera", компания DOW Agro Sciences, Канада).

Кроме того, также включены растения, которые благодаря использованию технологий рекомбинантной ДНК содержат модифицированное количество содержащихся веществ или новых веществ, в особенности, для улучшения выработки сырьевых материалов, например картофель, который вырабаты-

вает повышенные количества амилопектина (например, картофель Amflora®, компания BASF SE, Германия).

Композиции согласно изобретению являются в особенности пригодными для борьбы со следующими болезнями растений: *Albugo* spp. (белая ржавчина) на декоративных растениях, овощах (например, *A. Candida*) и подсолнухах (например, *A. tragorogonis*); *Alternaria* spp. (*Alternaria* пятнистость листьев) на овощах, рапсе (*A. brassicola* или *brassicae*), сахарной свекле (*A. tenuis*), фруктах, рисе, бобах, картофеле (например, *A. solani* или *alternata*), томатах (например, *A. solani* или *alternata*) и пшенице; *Aphanomyces* spp. на сахарной свекле и овощах; *Ascochyta* spp. на зерновых культурах и овощах, например *A. tritici* (антракноз) на пшенице и *A. hordei* на ячмене; *Bipolaris* и *Drechslera* spp. (телеоморф: *Cochliobolus* spp.) на кукурузе (например, *D. maydis*), зерновых культурах (например, *B. sorokiniana*: пятнистость), рисе (например, *B. oryzae*) и газоне; *Blumeria* (ранее *Erysiphe*) *graminis* (мучнистая роса) на зерновых культурах (например, на пшенице или ячмене); *Botrytis cinerea* (телеоморф: *Botryotinia fuckeliana*: серая гниль) на фруктах и ягодах (например, клубника), овощах (например, салат, морковь, сельдерей и капуста), рапсе, цветах, виноградных лозах, саженцах и пшенице; *Bremia lactucae* (ложная мучнистая роса) на салате; *Ceratocystis* (син. *Ophiostoma*) spp. (гниль или увядание) на широколиственных деревьях и вечнозеленых растениях, например *C. ulmi* (Голландская болезнь вяза) на вязах; *Cercospora* spp. (*Cercospora* пятнистость) на кукурузе, рисе, сахарной свекле (например, *C. beticola*), сахарном тростнике, овощах, кофе, сое (например, *C. sojae* или *C. kikuchii*) и рисе; *Cladosporium* spp. на томатах (например, *C. fulvum*: листовая плесень) и зерновых культурах, например *C. herbarum* (черные колосья) на пшенице; *Claviceps purpurea* (спорынья) на зерновых; *Cochliobolus* (анаморф: *Helminthosporium Bipolaris*) spp. (пятнистость листьев) на кукурузе (*C. carbonum*), зерновых (например, *C. sativus*, анаморф: *B. sorokiniana*) и рисе (например, *C. miyabeanus*, анаморф: *H. oryzae*); *Colletotrichum* (телеоморф: *Glomerella*) spp. (антракноз) на хлопке (например, *C. gossypii*), на кукурузе (например, *C. graminicola*), мягких фруктах, картофеле (например, *C. coccodes*: черное пятно), бобах (например, *C. lindemuthianum*) и сое (например, *C. truncatum* или *C. gloeosporioides*); *Corticium* spp., например *C. sasakii* (ризоктониоз) на рисе; *Corynespora cassiicola* (пятнистость листьев) на соевых бобах и декоративных растениях; *Cycloconium* spp., например *C. oleaginum* на оливковых деревьях; *Cylindrocarpum* spp. (например, рак плодового дерева или падение молодой лозы, телеоморф: *Nectria* или *Neonectria* spp.) на фруктовых деревьях, винограде (например, *C. liriodendri*, телеоморф: *Neonectria liriodendri*: заболевание черной ножки) и декоративных растениях; *Dematophora* (телеоморф: *Rosellinia*) некатрикс (корневая и стеблевая гниль) на соевых бобах; *Diaporthe* spp., например *D. phaseolorum* (выпревания) на соевых бобах; *Drechslera* (син. *Helminthosporium*, телеоморф: *Pyrrenophora*) spp. на кукурузе, зерновых, таких как ячмень (например, *D. teres*, сетчатая пятнистость) и пшенице (например, *D. tritici-repentis*: пиренофороз), рисе и газоне; *Esca* (отмирание, апоплексия) на виноградных лозах из-за *Formitiporia* (син. *Phellinus*) *punctata*, *F. mediterranea*, *Phaeoemoniella chlamydospora* (ранее *Phaeoacremonium chlamydosporum*), *Phaeoacremonium aleophilum* и/или *Botryosphaeria obtusa*; *Elsinoe* spp. на семечковых фруктах (*E. rugi*), мягких фруктах *E. veneta*: антракноз) и виноградных лозах (*E. ampelina*: антракноз); *Eutyloma oryzae* (головня листьев) на рисе; *Epicoccum* spp. (черная плесень) на пшенице; *Erysiphe* spp. (мучнистая роса) на сахарной свекле (*E. betae*), овощах (например, *E. pisi*), таких как тыквенные (например, *E. cichoracearum*), капуста, рапс (например, *E. cruciferae*); *Eutypa lata* (*Eutypa* рак или отмирание, анаморф: *Cytosporina lata*, син. *Libertella blepharis*) на плодовых деревьях, виноградных лозах и декоративных лесах; *Exserohilum* (син. *Helminthosporium*) spp. на кукурузе (например, *E. turcicum*); *Fusarium* (телеоморф: *Gibberella*) spp. (увядание, корневая или стволовая гниль) на различных растениях, таких как *F. graminearum* или *F. culmorum* (корневая гниль, короста или фузариоз) на зерновых культурах (например, пшенице или ячмене), *F. oxysporum* на томатах, *F. solani* (f. sp. *Glycines* сейчас син. *F. virguliforme*) и *F. tucumaniae* и *F. brasiliense* каждый вызывает синдром внезапной смерти соевых бобов, и *F. verticillioides* на кукурузе; *Gaeumannomyces graminis* (все) на зерновых культурах (например, пшенице или ячмене) и кукурузе; *Gibberella* spp. на зерновых культурах (например, *G. zeae*) и рисе (например, *G. fujikuroi*: болезнь Bakanae); *Glomerella singulata* на виноградных лозах, семечковых и других растениях и *G. gossypii* на хлопчатнике; комплекс коррозии зерна на рисе; *Guignardia bidwellii* (черная гниль) на виноградных лозах; *Gymnosporangium* spp. на розоцветных растениях и можжевельнике, например, *G. sabinae* (плесень) на грушах; *Helminthosporium* spp. (син. *Drechslera*, телеоморф: *Cochliobolus*) на кукурузе, зерновых культурах и рисе; *Hemileia* spp., например, *H. vastatrix* (листовая ржавчина кофе) на кофе; *Isariopsis clavisporea* (син. *Cladosporium vitis*) на виноградных лозах; *Macrophomina phaseolina* (син. *phaseoli*) (корневая и стволовая гниль) на соевых бобах и хлопчатнике; *Microdochium* (син. *Fusarium*) *nivale* (розовая снежная плесень) на зерновых культурах (например, пшенице или ячмене); *Microsphaera diffusa* (мучнистая роса) на соевых бобах; *Monilinia* spp., например *M. laxa*, *M. fructicola* и *M. fructigena* (порча цветения и веточки, бурая гниль) на косточковых плодах и других розоцветных растениях; *Mycosphaerella* spp. на зерновых культурах, бананы, мягких фруктах и молотых орехах, таких как, например, *M. graminicola* (анаморф: *Septoria tritici*, септориозное пятно) на пшенице или *M. fijiensis* (черная болезнь сигаток) на бананах; *Pegonospora* spp. (ложная мучнистая роса) на капусте (например, *P. brassicae*), рапсе (например, *P. parasitica*), луке (например, *P. destructor*), табаке (*P. tabacina*) и соевых бобах (например, *P. manshurica*); *Phakopsora pachyrhizi* и *P. meibomiae* (соевая коррозия) на соевых бобах; *Phialophora* spp.

например, на виноградных лозах (например, *P. tracheiphila* и *P. tetraspora*) и соевых бобах (например, *P. gregata*: стволовая гниль); *Phoma lingam* (корневая и стволовая гниль) на рапсе и капусте и *P. betae* (корневая гниль, пятнистость листьев и выпревание) на сахарной свекле; *Phomopsis* spp. на подсолнечнике, виноградных лозах (например, *P. viticola*: пятнистость тростника и листьев) и соевых бобах (например, стволовая гниль: *P. phaseoli*, телеоморф: *Diaporthe phaseolorum*); *Physoderma maydis* (бурая пятнистость) на кукурузе; *Phytophthora* spp. (увядание, кореньевая, листовая, плодовая и стволовая гниль) на различных растениях, таких как паприка и бахчевые (например, *P. capsici*), соевых бобах (например, *P. megasperma*, син. *P. sojae*), картофеле и томатах (например, *P. infestans*: фитофтороз) и широколиственных деревьях (например, *P. ramorum*: внезапная смерть дуба); *Plasmodiophora brassicae* (кила) на капусте, рапсе, редьке и других растениях; *Plasmopara* spp., например *P. viticola* (ложная мучнистая роса виноградной лозы) на виноградных лозах и *P. halstedii* на подсолнечниках; *Podosphaera* spp. (мучнистая роса) на розоцветных растениях, хмеле, семечковых и мягких фруктах, например *P. leucotricha* на яблоках; *Polytrichum* spp., например на зерновых культурах, таких как ячмень и пшеница (*P. graminis*) и сахарной свекле (*P. betae*), и таким образом, передаются вирусные заболевания; *Pseudocercospora herpotrichoides* (глазка, телеоморф: *Tapesia yallundae*) на зерновых культурах, например пшенице или ячмене; *Pseudoperonospora* (ложная мучнистая роса) на различных растениях, например *P. cubensis* на бахчевых или *P. humilis* на хмеле; *Pseudopeziza tracheiphila* (краснуха листьев винограда или "rotbrenner", анаморф: *Phialophora*) на виноградных лозах; *Ruccinia* spp. (коррозии) на различных растениях, например *P. triticea* (коричневая или листовая ржавчина), *P. striiformis* (полосатая или желтая ржавчина), *P. hordei* (мелкая ржавчина), *P. graminis* (стволовая или черная ржавчина) или *P. recondita* (коричневая или листовая ржавчина) на зерновых культурах, таких как, например, пшеница, ячмень или рожь, и спаржа (например, *P. asparagi*); *Rugospora* (анаморф: *Drechslera tritici-repentis* (пиренофороз) на пшенице или *P. teres* (сетчатая пятнистость) на ячмене; *Rydicularia* spp., например *P. oryzae* (телеоморф: *Magnaporthe grisea*, пирикулярриоз риса) на рисе и *P. grisea* на газоне и зерновых культурах; *Rhizium* spp. (выпревание) на газоне, рисе, кукурузе, пшенице, хлопчатнике, рапсе, подсолнечнике, соевых бобах, сахарной свекле, овощах и различных других растениях (например, *P. ultimum* или *P. arphanidermatum*); *Ramularia* spp., например *R. collo-cygni* (*Ramularia* пятнистость листьев, *Physiological* пятнистость листьев) на ячмене и *R. beticola* на сахарной свекле; *Rhizoctonia* spp. на хлопчатнике, рисе, картофеле, газоне, кукурузе, рапсе, картофеле, сахарной свекле, овощах и различных других растениях, например *R. solani* (корневая и стволовая гниль) на соевых бобах, *R. solani* (ризоктониоз) на рисе или *R. cerealis* (*Rhizoctonia* весеннее опадание) на пшенице или ячмене; *Rhizopus stolonifer* (черная плесень, гниль) на клубнике, моркови, капусте, винограде и томатах; *Rhynchosporium secalis* (ожог) на ячмене, ржи и тритикале; *Sarocladium oryzae* и *S. attenuatum* (гниль оболочки) на рисе; *Sclerotinia* spp. (гниль ствола и белая плесень) на овощах и полевых культурах, таких как рапс, подсолнечник (например, *S. sclerotiorum*) и соевых бобах (например, *S. rolfsii* или *S. sclerotiorum*); *Septoria* spp. на различных растениях, например *S. glycines* (коричневая пятнистость) на соевых бобах, *S. tritici* (септориозное пятно) на пшенице и *S.* (син. *Stagonospora*) *nodorum* (*Stagonospora* пятнистость) на зерновых культурах; *Uncinula* (син. *Erysiphe*) *pecator* (мучнистая роса, анаморф: *Oidium tuckeri*) на виноградных лозах; *Setosphaeria* spp. (опадание листьев) на кукурузе (например, *S. turcicum*, син. *Helminthosporium turcicum*) и газоне; *Sphaerotheca* spp. (головня) на кукурузе, (например, *S. reiliana*: головня головки), сорго и сахарном тростнике; *Sphaerotheca fuliginea* (мучнистая роса) на бахчевых; *Spongospora subterranea* (порошистая парша) на картофеле и, таким образом, передаются вирусные заболевания; *Stagonospora* spp. на зерновых культурах, например *S. nodorum* (*Stagonospora* пятнистость, телеоморф: *Leptosphaeria* [син. *Phaeosphaeria*] *nodorum*) на пшенице; *Synchytrium endobioticum* на картофеле (бородавочная болезнь картофеля); *Taphrina* spp., например *T. deformans* (болезнь курчавости листьев) на персике и *T. pruni* (заизюмление) на сливах; *Thielaviopsis* spp. (черная корневая гниль) на табаке, семечковых плодах, овощах, соевых бобах и хлопчатнике, например *T. basicola* (син. *Chalara elegans*); *Tilletia* spp. (общая головня и твердая головня) на зерновых культурах, таких как, например, *T. tritici* (син. *T. caries*, головня пшеницы) и *T. controversa* (карликовая головня) на пшенице; *Typhula incarnata* (серая снежная плесень) на ячмене или пшенице; *Urocystis* spp., например *U. occulta* (головня ствола) на ржи; *Uromyces* spp. (коррозия) на овощах, таких как бобы (например, *U. appendiculatus*, син. *U. phaseoli*) и сахарной свекле (например, *U. betae*); *Ustilago* spp. (пыльная головня) на зерновых культурах (например, *U. nuda* и *U. avenae*), кукурузе (например, *U. maydis*: головня кукурузы) и сахарном тростнике; *Venturia* spp. (короста) на яблоках (например, *V. inaequalis*) и грушах; и *Verticillium* spp. (увядание) на различных растениях, таких как фрукты и декоративные растения, виноград, мягкие фрукты, овощи и полевые культуры, например *V. dahliae* на клубнике, рапсе, картофеле и томатах.

В частности, композиции в соответствии с настоящим изобретением эффективны против патогенов растений в специальных культурах, таких как виноградная лоза, фрукты, хмель, овощи и табак, см. список выше.

Композиции согласно изобретению также пригодны для борьбы с патогенными грибами в области защиты хранящихся продуктов или урожая и в защите материалов. Термин "защита материалов" следует понимать, как обозначение защиты технических и неживых материалов, таких как адгезивы, клеи, дерево, бумага и картон, текстиль, кожа, дисперсионные краски, пластмассы, смазочные материалы, смазоч-

но-охлаждающие жидкости, волокна или ткани, против разрушения и заражения вредными микроорганизмами, такими как грибки и бактерии. Что касается защиты древесины и других материалов, то особое внимание уделяется следующим вредным грибкам: аскомицеты, такие как *Ophiostoma* spp., *Ceratocystis* spp., *Aureobasidium pullulans*, *Sclerophoma* spp., *Chaetomium* spp., *Hemicoloma* spp., *Petriella* spp., *Trichurus* spp.; Basidiomycetes, такие как *Coniophora* spp., *Coriolus* spp., *Gloeophyllum* spp., *Lentinus* spp., *Pleurotus* spp., *Poria* spp., *Serpula* spp. и *Tyromyces* spp., дейтеромицеты, такие как *Aspergillus* spp., *Cladosporium* spp., *Penicillium* spp., *Trichormia* spp., *Alternaria* spp., *Paecilomyces* spp., и зигомицеты, такие как *Mucor* spp., и, кроме того, в защите хранящихся продуктов и урожая следующие дрожжевые грибки достойны внимания: *Candida* spp. и *Saccharomyces cerevisiae*.

Способ обработки согласно настоящему изобретению также может быть использован в области защиты хранимых продуктов или урожая от поражения грибками и микроорганизмами. В соответствии с настоящим изобретением термин "хранимые продукты" следует понимать для обозначения натуральных веществ растительного или животного происхождения и их обработанных форм, которые были взяты из природного и жизненного цикла, для которых требуется долговременная защита. Хранимые продукты растительного происхождения, такие как растения или их части, например стебли, листья, клубни, семена, плоды или зерна, могут быть защищены в свежесобранном состоянии или в переработанном виде, например, когда предварительно сушат, смачивают, измельчают, растирают, прессуют или жарят, такой процесс также известен как послеуборочная обработка. Кроме того, подпадает под определение хранимых продуктов древесина, будь-то в виде сырой древесины, такой как строительная древесина, пилы и барьеры электроэнергии, или в виде готовых изделий, таких как мебель или предметы, изготовленные из дерева. Хранимые продукты животного происхождения представляют собой шкуры, кожу, меха, волосы и т.п. Комбинации согласно настоящему изобретению могут предотвратить нежелательные эффекты, такие как гниение, обесцвечивание или плесень. Предпочтительно "хранимые продукты" следует понимать для обозначения натуральных веществ растительного происхождения и их обработанных форм, более предпочтительно плоды и их обработанные формы, такие как семечковые, косточковые фрукты, мягкие фрукты и цитрусовые фрукты и их обработанные формы.

Материалы для размножения растений можно обрабатывать с помощью композиций согласно изобретению профилактически или при, или перед посадкой или высадкой.

Изобретение также относится к агрохимическим композициям, содержащим вспомогательное вещество и по меньшей мере одно соединение I и по меньшей мере один пестицид II в соответствии с изобретением.

Агрохимическая композиция содержит фунгицидно эффективное количество соединения I и пестицида II. Термин "эффективное количество" обозначает количество композиции или соединения I, которое является достаточным для борьбы с вредными грибками на культивируемых растениях или защитных материалах и которое не приводит к значительному ущербу в отношении обрабатываемых растений. Такое количество может варьироваться в широком диапазоне и зависит от различных факторов, например от обрабатываемого культивируемого растения или материала, и от климатических условий, и конкретного используемого соединения I.

Соединения I и пестицид II, их N-оксиды и соли могут быть превращены в стандартные типы агрохимических композиций, например растворы, эмульсии, суспензии, пылеподобные порошки, порошки, пасты, гранулы, прессованные изделия, капсулы, а также их смеси. Примеры для типов композиций представляют собой суспензии (например, SC, OD, FS), эмульгируемые концентраты (например, EC), эмульсии (например, EW, EO, ES, ME), капсулы (например, CS, ZC), пасты, пастилки, смачиваемые порошки или пылеподобные порошки (например, WP, SP, WS, DP, DS), прессованные изделия (например, BR, TB, DT), гранулы (например, WG, SG, GR, FG, GG, MG), инсектицидные препараты (например, LN), так же как и гелевые препаративные формы для обработки материалов размножения растений, таких как семена (например, GF). Эти и дополнительные виды составов определены в "Catalogue of pesticide formulation types and international coding system", технической монографии № 2, 6 изд., май 2008, CropLife International.

Композиции получают известным способом, как описано в Mollet и Grube-mann, Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001; или Knowles, New developments in crop protection product formulation, Agrow Reports DS243, T&F Informa, London, 2005.

Подходящими вспомогательными веществами являются растворители, жидкие носители, твердые носители или наполнители, поверхностно-активные вещества, диспергирующие вещества, эмульгирующие вещества, смачивающие вещества, адьюванты, солубилизаторы, вещества, способствующие проникновению, защитные коллоиды, агенты прилипания, загустители, увлажняющие вещества, репелленты, аттрактанты, стимуляторы поедания, компатибилизаторы, бактерициды, вещества против замораживания, вещества против пенообразования, красители, вещества для повышения клейкости и связывающие вещества.

Подходящими растворителями и жидкими носителями являются вода и органические растворители, такие как фракции нефти с температурой кипения от средней до высокой, например керосин, соляровое масло; масла растительного или животного происхождения; алифатические, циклические и ароматиче-

ские углеводороды, например толуол, парафин, тетрагидронафталин, алкилированные нафталины; спирты, например этанол, пропанол, бутанол, бензиловый спирт, циклогексанол; гликоли; ДМСО; кетоны, например циклогексанон; сложные эфиры, например лактаты, карбонаты, сложные эфиры жирных кислот, γ -бутиролактон; жирные кислоты; фосфонаты; амины; амиды, например N-метилпирролидон, диметиламиды жирных кислот и их смеси.

Подходящими твёрдыми носителями или наполнителями являются минеральные земли, например силикаты, силикагели, тальк, каолины, известняк, известь, мел, глины, доломит, диатомовая земля, бентонит сульфат, кальция, сульфат магния, оксид магния; полисахариды, например целлюлоза, крахмал; удобрения, например сульфат аммония, фосфат аммония, нитрат аммония, мочевины; продукты растительного происхождения, например зерновая мука, мука древесной коры, древесная мука, мука ореховой скорлупы и их смеси.

Подходящими поверхностно-активными веществами являются поверхностно-активные соединения, такие как анионные, катионные, неионные и амфотерные поверхностно-активные вещества, блок-полимеры, полиэлектролиты и их смеси. Такие поверхностно-активные вещества могут применяться в качестве эмульгирующего вещества, диспергирующего вещества, солюбилизатора, смачивающего вещества, вещества, способствующего проникновению, защитного коллоида или адьюванта. Примеры поверхностно-активных веществ перечислены в McCutcheon's, т. 1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008 (изд. International или изд. North American).

Подходящими анионными поверхностно-активными веществами являются соли щелочных, щелочно-земельных металлов или аммониевые соли - сульфонаты, сульфаты, фосфаты, карбоксилаты и их смеси. Примерами сульфонатов являются алкиларилсульфонаты, дифенилсульфонаты, α -олефин сульфонаты, лигнин сульфонаты, сульфонаты жирных кислот и масел, сульфонаты этоксилированных алкилфенолов, сульфонаты алкоксилированных арилфенолов, сульфонаты конденсированных нафталинов, сульфонаты додецил- и тридецилбензолов, сульфонаты нафталенов и алкилнафталенов, сульфосукцинаты или сульфосукцинаматы. Примерами сульфатов являются сульфаты жирных кислот и масел, этоксилированные алкилфенолы, спирты, этоксилированные спирты или сложные эфиры жирных кислот. Примерами фосфатов являются сложные эфиры фосфорной кислоты. Примерами карбоксилатов являются алкилкарбоксилаты и карбоксилированные этоксилаты спирта или алкилфенола.

Подходящими неионными поверхностно-активными веществами являются алкоксилаты, N-замещенные амиды жирных кислот, пиримидиноксиды, сложные эфиры, поверхностно-активные вещества на основе сахаров, полимерные поверхностно-активные вещества и их смеси. Примерами алкоксилатов являются такие соединения, как спирты, алкилфенолы, амины, амиды, арилфенолы, жирные кислоты или сложные эфиры жирных кислот, которые были алкоксилированы 1-50 экв. Для алкоксилирования может применяться этиленоксид и/или пропиленоксид, предпочтительно этиленоксид. Примерами N-замещенных амидов жирных кислот являются глюкамиды жирных кислот или алканоламиды жирных кислот. Примерами сложных эфиров являются сложные эфиры жирных кислот, сложные эфиры глицерина или моноглицериды. Примерами поверхностно-активных веществ на основе сахаров являются сорбитаны, этоксилированные сорбитаны, сложные эфиры сахарозы и глюкозы или алкилполиглюкозиды. Примерами полимерных поверхностно-активных веществ являются гомо- или сополимеры винилпирролидона, виниловых спиртов или винилацетата.

Пригодные катионные поверхностно-активные вещества представляют собой четвертичные поверхностно-активные вещества, например соединения четвертичного аммония с одной или двумя гидрофобными группами или солями длинноцепочечных первичных пиримидинов. Пригодные амфотерные поверхностно-активные вещества представляют собой алкилбетаины и имидазолины. Пригодные блок-сополимеры представляют собой блок-сополимеры типа А-В или типа А-В-А, которые содержат блоки полиэтиленоксида и полипропиленоксида, или типа А-В-С, которые содержат алканол, полиэтиленоксид и полипропиленоксид. Пригодные полиэлектролиты представляют собой поликислоты или полиоснования. Примерами поликислот являются щелочные соли полиакриловой кислоты или гребнеобразные полимеры поликислот. Примерами полиоснований являются поливиниламины или полиэтиленамины.

Пригодные вспомогательные вещества являются соединениями, которые не отличаются существенной или даже не пестицидной активностью и которые улучшают производительность соединения I в отношении цели. Примерами являются поверхностно-активные вещества, минеральные или растительные масла и другие дополнительные вещества. Дальнейшие примеры перечислены в Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, chapter 5.

Пригодные загустители представляют собой полисахариды (например, ксантановую смолу, карбоксиметилцеллюлозу), неорганические глины (органически модифицированные или не модифицированные), поликарбоксилаты и силикаты.

Пригодные бактерициды представляют собой производные бронопола и изотиазолинона, такие как алкилизотиазолиноны и бензизотиазолиноны.

Пригодными антифризами являются этиленгликоль, пропиленгликоль, мочевины и глицерин.

Пригодные антипенообразователи представляют собой силиконы, длинноцепочечные спирты и со-

ли жирных кислот.

Пригодные красители (например, красный, синий или зеленый) представляют собой пигменты низкой растворимости в воде и водорастворимые красители. Примерами являются неорганические красители (например, оксид железа, оксид титана, гексацианоферрат железа) и органические красители (например, ализарин-, азо- и фталоцианиновые красители).

Пригодные вещества для повышения клейкости или связующие вещества представляют собой поливинилпирролидоны, поливинилацетаты, поливиниловые спирты, полиакрилаты, биологические или синтетические воски и простые эфиры целлюлозы.

Примеры типов композиций и их получение (где активные вещества обозначают по меньшей мере одно соединение I и одно соединение II).

1) Растворимые в воде концентраты (SL, LS)

10-60 мас.% активных веществ и 5-15 мас.% смачивающего агента (например, алкоксилаты спирта) растворяли в воде и/или в водорастворимом растворителе (например, спирты) до 100 мас.%. Активное вещество растворяется при разбавлении водой.

2) Концентраты дисперсий (DC)

5-25 мас.% активных веществ и 1-10 мас.% диспергатора (например, поливинилпирролидон) растворяли в органическом растворителе (например, циклогексанон) до 100 мас.%. При разведении водой образуется дисперсия.

3) Концентраты эмульсий (EC)

15-70 мас.% активных веществ и 5-10 мас.% эмульгаторов (например, кальций додецилбензолсульфонат и этоксилат касторового масла) растворяли в водонерастворимом органическом растворителе (например, ароматический углеводород) до 100 мас.%. При разведении водой образуется эмульсия.

4) Эмульсии (EW, EO, ES)

5-40 мас.% активных веществ и 1-10 мас.% эмульгаторов (например, кальций додецилбензолсульфонат и этоксилат касторового масла) растворяли в 20-40 мас.% водонерастворимом органическом растворителе (например, ароматический углеводород). Эту смесь вводили в воду до 100 мас.% с помощью эмульгирующего устройства и доводили до гомогенной эмульсии. При разведении водой образуется эмульсия.

5) Суспензии (SC, OD, FS)

В шаровой мельнице с мешалкой 20-60 мас.% активных веществ раздалбливали с добавлением 2-10 мас.% диспергаторов и смачивающих агентов (например, натрий лигносульфонат и спирт этоксилат), 0,1-2 мас.% загустителя (например, ксантановая камедь) и воды до 100 мас.%, чтобы получить тонкую суспензию активного вещества. При разведении водой образуется стабильная суспензия активного вещества. Для типа композиции FS добавляли до 40 мас.% связующего вещества (например, поливиниловый спирт).

6) Диспергируемые в воде гранулы и водорастворимые гранулы (WG, SG)

50-80 мас.% активных веществ тонко измельчали при добавке диспергатора и смачивающих агентов (например, натрий лигносульфонат и спирт этоксилат) до 100 мас.% и получали как вододиспергируемые или водорастворимые гранулы с помощью технических средств (например, экструзия, оросительная колонна, псевдоожиженный слой). При разведении водой образуется стабильная дисперсия или раствор активного вещества.

7) Диспергируемые в воде порошки и водорастворимые порошки (WP, SP, WS)

50-80 мас.% активных веществ перемальвали в роторно-статорной мельнице с добавлением 1-5 мас.% диспергаторов (например, натрий лигносульфонат), 1-3 мас.% смачивающих агентов (например, спирт этоксилат) и твердого носителя (например, силикагель) до 100 мас.%. При разведении водой образуется стабильная дисперсия или раствор активного вещества.

8) Гель (GW, GF)

В шаровой мельнице с мешалкой 5-25 мас.% активных веществ раздалбливали с добавлением 3-10 мас.% диспергаторов (например, натрий лигносульфонат), 1-5 мас.% загустителя (например, карбоксиметилцеллюлоза) и воды до 100 мас.% с получением тонкой суспензии активного вещества. При разведении водой образуется стабильная суспензия активного вещества.

9) Микроэмульсия (ME)

5-20 мас.% активных веществ добавляли к 5-30 мас.% органической смеси растворителя (например, диметиламид жирных кислот и циклогексанон), 10-25 мас.% смеси поверхностно-активных веществ (например, спирт этоксилат и арилфенол этоксилат) и воды до 100%. Эту смесь перемешивают в течение 1 ч с получением спонтанно термодинамически устойчивой микроэмульсии.

10) Микрокапсулы (CS)

Масляная фаза, которая содержит 5-50 мас.% активных веществ, 0-40 мас.% водонерастворимого органического растворителя (например, ароматический углеводород), 2-15 мас.% акриловых мономеров (например, метилметакрилат, метакриловая кислота и ди- или триакрилат) диспергировали в водном растворе защитного коллоида (например, поливиниловый спирт). Радиальная полимеризация инициирована результатами радикального инициатора в формировании микрокапсул поли(мет)акрилата. Альтерна-

тивным образом, масляная фаза, которая содержит 5-50 мас.% соединения I в соответствии с настоящим изобретением, 0-40 мас.% водонерастворимого органического растворителя (например, ароматический углеводород) и изоцианатный мономер (например, дифенилметен-4,4'-диизоцианат), диспергировали в водном растворе защитного коллоида (например, поливиниловый спирт). Добавление полиамин (например, гексаметилендиамин) приводит к образованию микрокапсул полимочевины. Количество мономеров составляет 1-10 мас.%. Мас.% относится к общей CS композиции.

11) Тонкодисперсные порошки (DP, DS)

1-10 мас.% активных веществ тонко перемалывали и тщательно смешивали с твердым носителем (например, тонкодисперсный каолин) до 100 мас.%.

12) Гранулы (GR, FG)

0,5-30 мас.% активных веществ тонко перемалывали и сочетали с твердым носителем (например, силикат) до 100 мас.%. Гранулирование достигнуто путем экструзии, сушки распылением или псевдоожиженным слоем.

13) Жидкости с ультранизким объемом (UL)

1-50 мас.% активных веществ растворяли в органическом растворителе (например, ароматический углеводород) до 100 мас.%.

Типы композиций 1-13 могут необязательно содержать дополнительные вспомогательные вещества, такие как 0,1-1 мас.% бактерицидов, 5-15 мас.% антифризов, 0,1-1 мас.% антипенообразователей и 0,1-1 мас.% красителей.

Агрохимические композиции обычно содержат между 0,01 и 95%, предпочтительно между 0,1 и 90% и, в частности, между 0,5 и 75% по массе активного вещества. Активные вещества используются с чистотой от 90 до 100%, предпочтительно от 95 до 100% (согласно ЯМР-спектру).

Растворы для обработки семян (LS), суспо-эмульсии (SE), текучие концентраты (FS), порошки для сухой обработки (DS), водорастворимые порошки для жидкостной обработки (WS), водорастворимые порошки (SS), эмульсии (ES), эмульгируемые концентраты (EC) и гели (GF) обычно используются с целью обработки материала для размножения растений, в частности семян. Композиции, о которых идет речь, обеспечивают после от 2- до 10-кратного разбавления, концентрации активного вещества от 0,01 до 60 мас.%, предпочтительно от 0,1 до 40 мас.% в готовых к применению препаратах. Применение может проводиться перед или во время посева. Способы применения или обработки соединения I и соединения II и их композиций, соответственно, на материал для размножения растений, особенно семена, включают протравливание, покрытие, гранулирование, напыление, пропитывание и методы применения в бороздках материала для размножения. Предпочтительно соединение I и пестицид II или их композиции, соответственно, применяются на материал для размножения растений таким способом, что всхожесть не индуцируется, например, посредством протравливания семян, гранулирования, покрытия и напыления.

При использовании для защиты растений количества применяемых активных веществ представляют собой в зависимости от желаемого эффекта от 0,001 до 2 кг/га, предпочтительно от 0,005 до 2 кг/га, более предпочтительно от 0,05 до 0,9 кг/га и, в частности, от 0,1 до 0,75 кг/га.

В обработке материала для размножения растений, такого как семена, например, опылением, покрытием или поливом семян количества активного вещества, которые в целом требуются, составляют от 0,1 до 1000 г, предпочтительно от 1 до 1000 г, более предпочтительно от 1 до 100 г и наиболее предпочтительно от 5 до 100 г на 100 кг растительного материала для размножения (предпочтительно семена).

При использовании для защиты материалов или хранимых продуктов количество применяемого активного вещества зависит от вида области применения и от желаемого эффекта. Количества, которые обычно применяют при защите материалов, составляют от 0,001 г до 2 кг, предпочтительно от 0,005 г до 1 кг действующего вещества на кубометр обрабатываемого материала.

Различные типы масел, смачивающих агентов, адъювантов, удобрений или микроэлементов и дополнительные пестициды (например, гербициды, инсектициды, фунгициды, регуляторы роста, антидоты) могут быть добавлены к активным веществам или в композиции, которые их содержат в качестве премикса или, при необходимости, вещества не немедленного использования (баковая смесь). Эти агенты могут быть смешаны с композициями в соответствии с настоящим изобретением в массовом соотношении от 1:100 до 100:1, предпочтительно от 1:10 до 10:1.

Пользователь применяет композицию в соответствии с настоящим изобретением, как правило, из устройства подготовки вещества перед применением, ранцевого опрыскивателя, емкости выливного прибора, распылительной установки или системы орошения. Как правило, агрохимическая композиция разбавляется водой, буфером и/или другими вспомогательными веществами до нужной концентрации для применения, и таким образом, получают готовые к использованию растворы для опрыскивания или агрохимические композиции в соответствии с настоящим изобретением. Как правило, от 20 до 2000 л, предпочтительно от 50 до 400 л готового к использованию раствора для опрыскивания применяются на гектар сельскохозяйственной полезной площади.

В композициях соотношения соединения преимущественно выбирают таким образом, чтобы произвести синергический эффект.

Термин "синергический эффект" следует понимать, в частности, как то, что определяется по фор-

муле Колби (Colby, S.R., "Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide combinations", Weeds, 15, pp. 20-22, 1967).

Термин "синергический эффект" следует понимать, как то, что определяется применением метода Таммса (Tammes, P.M.L., "Isoboles, a graphic representation of synergism in pesticides", Netherl. J. Plant Pathol. 70, 1964).

Активные соединения, отдельно или совместно, получают в виде исходного раствора, содержащего 25 мг активного соединения, который доводят до 10 мл, используя смесь ацетона и/или ДМСО и эмульгатора Uniperol® EL (смачивающий агент с эмульгирующим и диспергирующим действием на основе этоксилированных алкилфенолов) в соотношении по объему растворителя/эмульгатора 99:1. Затем смесь доводят до 100 мл водой. Этот исходный раствор разбавляют смесью растворителя/эмульгатора/воды, чтобы получить концентрацию активного соединения, указанную ниже.

Визуально определенные проценты зараженной площади листьев превращают в эффективность в % необработанного контроля.

Эффективность (E) рассчитывается следующим образом, используя формулу Эббота:

$$E = (1 - \alpha/\beta) \cdot 100$$

где α соответствует поражению грибами обработанных растений в %, и

β соответствует поражению грибами необработанных (контрольных) растений в %.

Эффективность, равная 0, означает, что уровень инфекции обработанных растений соответствует эффективности необработанных контрольных растений; эффективность 100 означает, что обработанные растения не были заражены.

Ожидаемая эффективность комбинаций биологически активных соединений определяют по формуле Колби (Colby, S.R. "Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide combinations", Weeds, 15, pp. 20-22, 1967) и сравнивают с наблюдаемой эффективностью

$$E = x + y - x \cdot y/100$$

формула Колби

где E - ожидаемая эффективность, выраженная в % необработанного контроля, при использовании смеси активных соединений A и B в концентрациях a и b,

x - эффективность, выраженная в % необработанного контроля, при использовании активного соединения A в концентрации a,

y - эффективность, выраженная в % необработанного контроля, при использовании активного соединения B в концентрации b.

Фунгицидное действие композиции в соответствии с изобретением может быть показано с помощью тестов, описанных ниже.

Микротест.

Активные соединения были сформулированы отдельно в качестве исходного раствора, имеющего концентрацию 10000 м.д. в диметилсульфоксиде.

Продукт сульфосафлор использовали как коммерческую окончательную композицию и разбавляли водой до указанной концентрации активного соединения.

M1. Действие против возбудителя фитофтороза *Phytophthora infestans* в тесте с микротитрационными планшетами (Phyitin).

Исходные растворы смешивали в соответствии с соотношением, пипеткой переносили на микротитрационный планшет (МТР) и разбавляли водой до указанных концентраций. Затем добавляли спорную суспензию *Phytophthora infestans*, содержащую питательную водную среду на основе горохового сока или среду DDC. Планшеты помещали в камеру, насыщенную водным паром при температуре 18°C. Используя фотометр поглощения измеряли МТР при 405 нм через 7 дней после инокуляции.

M2. Действие против серой гнили *Botrytis cinerea* в тесте с микротитрационными планшетами (Botcsi).

Исходные растворы смешивали в соответствии с соотношением, пипеткой переносили на микротитрационный планшет (МТР) и разбавляли водой до указанных концентраций. Затем добавляли спорную суспензию *Botrytis cinerea* в водном растворе биомальта или дрожжевого бактопептон-ацетата натрия. Планшеты помещали в камеру, насыщенную водным паром при температуре 18°C. Используя фотометр поглощения измеряли МТР при 405 нм через 7 дней после инокуляции.

M3. Действие против пирикулярноза риса *Puccinia oryzae* в тесте с микротитрационными планшетами (Pugior).

Исходные растворы смешивали в соответствии с соотношением, пипеткой переносили на микротитрационный планшет (МТР) и разбавляли водой до указанных концентраций. Затем добавляли спорную суспензию *Puccinia oryzae* в водном растворе биомальта или дрожжевого бактопептон-ацетата натрия. Планшеты помещали в камеру, насыщенную водным паром при температуре 18°C. Используя фотометр поглощения измеряли МТР при 405 нм через 7 дней после инокуляции.

M4. Действие против пятнистости листьев на пшенице, вызванной *Septoria tritici* (Septtr).

Исходные растворы смешивали в соответствии с соотношением, пипеткой переносили на микро-

титрационный планшет (МТР) и разбавляли водой до указанных концентраций. Затем добавляли спорую суспензию *Septoria tritici* в водном растворе биомальта или дрожжевого бактопептон-ацетата натрия. Планшеты помещали в камеру, насыщенную водным паром при температуре 18°C. Используя фотометр поглощения измеряли МТР при 405 нм через 7 дней после инокуляции.

М5. Действие против ранней гнили, вызванной *Alternaria solani* (Alteso).

Исходные растворы смешивали в соответствии с соотношением, пипеткой переносили на микро-титрационный планшет (МТР) и разбавляли водой до указанных концентраций. Затем добавляли спорую суспензию *Alternaria solani* в водном растворе биомальта или дрожжевого бактопептон-ацетата натрия. Планшеты помещали в камеру, насыщенную водным паром при температуре 18°C. Используя фотометр поглощения измеряли МТР при 405 нм через 7 дней после инокуляции.

М6. Действие против пятнистости листьев пшеницы, вызванной *Leptosphaeria nodorum* (Leptno).

Исходные растворы смешивали в соответствии с соотношением, пипеткой переносили на микро-титрационный планшет (МТР) и разбавляли водой до указанных концентраций. Затем добавляли спорую суспензию *Leptosphaeria nodorum* в водном растворе биомальта или дрожжевого бактопептон-ацетата натрия. Планшеты помещали в камеру, насыщенную водным паром при температуре 18°C. Используя фотометр поглощения измеряли МТР при 405 нм через 7 дней после инокуляции.

Измеренные параметры сравнивали с ростом контрольного варианта без активного соединения (100%) и пустым значением без грибка и активного соединения для определения относительного роста в % патогенных микроорганизмов в соответствующих активных соединениях.

Эти проценты были преобразованы в показатели эффективности.

Эффективность, равная 0, означает, что уровень роста возбудителей соответствует эффективности необработанного контроля; эффективность 100 означает, что возбудители не росли.

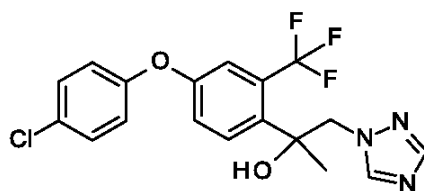
Ожидаемые эффективности смесей активных соединений определяют по формуле Колби (Colby, S.R. "Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide combinations", Weeds, 15., pp. 20-22, 1967) и сравнивают с наблюдаемыми эффективностями.

Результаты.

М5. Alteso.

Активное соединение/ активная смесь	Концентрация (м.д.)	Смесь	Наблюдаемая эффективность	Расчетная эффективность в соотв. с Колби (%)	Синергизм (%)
I-3*	0.001	-	9		
Трифлумезопирим (II-7)	0.25	-	36		
I-3* Трифлумезопирим (II-7)	0.001 0.25	1 : 250	33	15	18

* I-3: 2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол



ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

- Пестицидная композиция, которая содержит:
 - в качестве компонента I соединение I-3 2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол и
 - в качестве компонента II трифлумезопирим (мезоионный) (II-7).
- Композиция по п.1, где компонент I и компонент II присутствуют в синергически эффективном количестве.
- Композиция по п.1 или 2, где компонент I и компонент II присутствуют в общем массовом соотношении от 100:1 до 1:100.
- Композиция по любому из пп.1-3, дополнительно содержащая агрохимическое вспомогательное вещество.
- Применение пестицидной композиции по любому из пп.1-4 для борьбы с фитопатогенными грибами.
- Способ борьбы с фитопатогенными грибами, включающий обработку грибков или материалов, растений, почвы или семян, которые необходимо защитить от поражения грибами, пестицидной компо-

зицией по любому из пп.1-4 в эффективном количестве.

7. Материал для размножения растений, покрытый компонентами I и II, как они определены в пестицидной композиции по любому из пп.1-4, в количестве от 0,1 до 10 кг активных веществ на 100 кг семян.

