

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(21) **202092974** (13) **A1**

(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ**

(43) Дата публикации заявки
2021.04.09

(51) Int. Cl. *A01N 25/04* (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01N 43/653 (2006.01)

(22) Дата подачи заявки
2019.05.30

(54) **СТАБИЛИЗИРОВАННАЯ ФУНГИЦИДНАЯ КОМПОЗИЦИЯ, СОДЕРЖАЩАЯ ЦИКЛОДЕКСТРИН**

(31) **62/679,561**

(72) Изобретатель:

(32) **2018.06.01**

**Ли Дуй, Мэтью Филип, Ву Тай-Тех,
Занг Ян, Дас Аньян (US)**

(33) **US**

(86) **PCT/US2019/034639**

(74) Представитель:

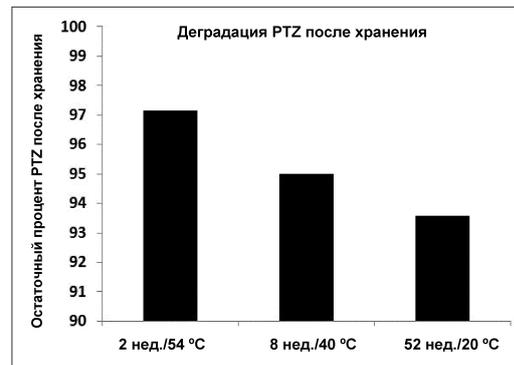
(87) **WO 2019/232201 2019.12.05**

Беляева Е.Н. (BY)

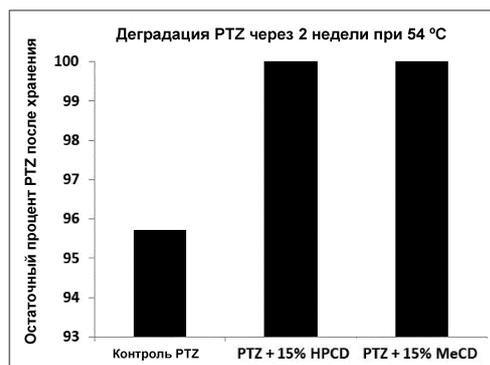
(71) Заявитель:

БАЙЕР КРОПСАЙЕНС ЛП (US)

(57) Изобретение касается жидкой препаративной формы, содержащей: а) триазольный и/или пиразольный фунгицид и б) по меньшей мере одно циклодекстриновое соединение. Изобретение также касается способа подавления деградации триазольного фунгицида в жидкой препаративной форме, включающего: (а) упаковку препаративной формы в подходящий контейнер; (b) уменьшение воздействия кислорода на триазольный фунгицид в препаративной форме по сравнению с воздействием кислорода на триазольный фунгицид, когда препаративная форма контактирует с воздухом; и (с) закрытие или герметизацию контейнера.



В



A1

202092974

202092974

A1

СТАБИЛИЗИРОВАННАЯ ФУНГИЦИДНАЯ КОМПОЗИЦИЯ, СОДЕРЖАЩАЯ ЦИКЛОДЕКСТРИН

ССЫЛКА НА РОДСТВЕННЫЕ ЗАЯВКИ

[0001] Для настоящей заявки испрашивается приоритет по предварительной заявке США № 62/679,561 от 1 июня 2018 г. Содержание указанной патентной заявки полностью включено в настоящую заявку посредством ссылки.

ОБЛАСТЬ ТЕХНИКИ

[0002] Настоящее изобретение относится к стабилизированным жидким препаративным формам, содержащим фунгициды, к способу их получения и к способу борьбы с фитопатогенными грибами и вредителями для защиты посевов.

ПРЕДПОСЫЛКИ К СОЗДАНИЮ ИЗОБРЕТЕНИЯ

[0003] В агрохимической отрасли триазолы являются важным классом фунгицидов. Одним таким фунгицидным триазолом является 2-[2-(1-хлороциклопропил)-3-(2-хлоро-фенил)-2-гидрокси-пропил]-2,4-дигидро-3Н-1,2,4-триазол-3-тион, также известный как протиоконазол. С 2004 года компанией Bayer CropScience на рынке было представлено много продуктов на основе протиоконазола под такими брендами, как PROCEED[®], PRALINE[®], INPUT[®], RAXIL[®] и PROSARO[®].

[0004] К сожалению, протиоконазол подвержен химической деградации, и водные дисперсии протиоконазола, в частности, микродисперсии, могут быть химически нестабильными, в частности, в готовых к употреблению препаративных формах, когда протиоконазол содержится в низких концентрациях, что значительно сокращает срок их хранения. При хранении при определенных условиях, например, при повышенной температуре, под воздействием светового излучения и при контакте с кислородом, протиоконазол может распадаться до 2-(1-хлороциклопропил)-1-(2-хлорфенил)-3-(1Н-1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ола (также известного как протиоконазол-дестео).

[0005] В препаративных формах с низкой концентрацией с течением времени наблюдались потери до пятнадцати массовых процентов активного ингредиента. В препаративных формах сельскохозяйственных химикатов,

содержащих один или более активных ингредиентов (АИ), номинальная (указанная в инструкции) концентрация которых составляет более 1 массового процента (1%), но менее 20 массовых процентов (20%), в соответствии с требованиями действующих нормативных актов активные ингредиенты должны присутствовать в количествах, отклоняющихся не более чем на 5 массовых процентов от указанной в инструкции концентрации. Если номинальная концентрация составляет $<1\%$, тогда одобренный диапазон по умолчанию равен $\pm 10\%$; если номинальная концентрация составляет $> 20\%$, тогда одобренный диапазон по умолчанию равен $\pm 3\%$. Важно минимизировать уровень деградации протиокназола, чтобы соблюсти такие установленные пределы.

[0006] Существует необходимость в разработке химически стабильных водных дисперсий протиокназола и способов их получения для сохранения противогрибковой активности этих продуктов. Химически стабильные водные дисперсии протиокназола и других триазольных фунгицидов должны выдерживать жесткие условия хранения, включая контакт с кислородом, высокие температуры и воздействие света, в течение длительных периодов времени без значительной деградации.

КРАТКОЕ ИЗЛОЖЕНИЕ СУЩНОСТИ ИЗОБРЕТЕНИЯ

[0007] В некоторых вариантах осуществления изобретения, настоящее изобретение относится к жидкой препаративной форме, содержащей а) триазольный фунгицид; и б) по меньшей мере, одно циклодекстриновое соединение. Триазольный фунгицид может быть выбран из группы, состоящей из азакназола, битертанола, бромукназола, ципроконазола, диклобутразола, дифенокназола, диниконазола, диниконазола-М, эпоксиконазола, этаконазола, фенбукназола, флухинконазола, флусилазола, флутриафола, фурконазола, фурконазола-цис, гексакназола, имибенконазола, ипконазола, метконазола, миклбутанила, паклбутразола, пенконазола, пропиконазола, протиокназола, хинконазола, симеконазола, тебукназола, тетраконазола, триадимефона, триадименола, тритиконазола, униканозола, униканозола-Р, вориконазола, и 1-(4-хлорфенил)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)циклопентанола.

[0008] В других вариантах осуществления изобретения, настоящее изобретение относится к жидкой препаративной форме, содержащей а) пиразол-содержащий фунгицид; и б) по меньшей мере, одно циклодекстриновое

соединение. Пиразольный фунгицид может быть выбран из группы, состоящей из бензовиндифлупира, биксафена, флуиндапира, флуксапироксада, фураметпира, изопиразама, пенфлуфена, пентиопирада, пирифлуметофена, пирапропоина, рабензазола и седаксана.

[0009] В других вариантах осуществления настоящее изобретение относится к жидкой препаративной форме, содержащей а) смесь триазольного и пиразольного фунгицида и б) по меньшей мере, один циклодекстрин.

[0010] В некоторых аспектах, циклодекстриновое соединение представляет собой α -циклодекстрин, β -циклодекстрин или γ -циклодекстрин. В одном аспекте, циклодекстриновое соединение представляет собой β -циклодекстрин. Циклодекстриновое соединение может представлять собой модифицированный циклодекстрин с одной или более заменами в гидроксильной группе. В некоторых вариантах осуществления изобретения замена выбрана из группы, состоящей из алкильной группы, гидроксиалкильной группы, алкоксиалкильной группы, сульфоалкильной группы, сульфоалкилэфирной группы и группы сахара.

[0011] В других вариантах осуществления изобретения, модифицированный циклодекстрин выбран из группы, состоящей из метилциклодекстрина, гидроксиэтилциклодекстрина, 2-гидроксипропилциклодекстрина, глюкозилциклодекстрина, сульфобутилциклодекстрина, сульфобутилэфирциклодекстрина, глюкозилциклодекстрина и мальтозилциклодекстрина.

[0012] В некоторых вариантах осуществления изобретения, циклодекстриновое соединение выбрано из группы, состоящей из γ -циклодекстрина, α -циклодекстрина, β -циклодекстрина, глюкозил- α -циклодекстрина, мальтозил- α -циклодекстрина, глюкозил- β -циклодекстрина, мальтозил- β -циклодекстрина, 2-гидрокси- β -циклодекстрина, 2-гидроксипропил- β -циклодекстрина (HP β CD), 2-гидроксипропил- γ -циклодекстрина, гидроксиэтил- β -циклодекстрина метил- β -циклодекстрина, сульфобутиловый эфир- α -циклодекстрина, сульфобутиловый эфир- β -циклодекстрина, и сульфобутиловый эфир- γ -циклодекстрина, диметил- β -циклодекстрина (DM β CD), триметил- β -циклодекстрина (TM β CD), произвольно метилированного- β -циклодекстрина (RM β CD), гидроксиэтил- β -циклодекстрина (HE β CD), 3-гидроксипропил- β -циклодекстрина (3HP β CD), 2,3-дигидроксипропил- β -циклодекстрина (DHP β CD), 2-гидроксиизобутил- β -циклодекстрина (HIB β CD), сульфобутиловый эфир- β -

циклодекстрина (SBE β CD), глюкозил- β -циклодекстрина (G1 β CD), мальтозил- β -циклодекстрина (G2 β CD), сульфозтиловый эфир β -циклодекстрина и сульфопропиловый эфир- β -циклодекстрина.

[0013] В некоторых аспектах, жидкая препаративная форма дополнительно содержит одно или более дополнительных агрохимически активных веществ. В других аспектах, жидкая препаративная форма также содержит, по меньшей мере, один эмульгатор.

[0014] Агрохимически активные вещества могут представлять собой один или более инсектицидов, нематоцидов, фунгицидов, регуляторов роста насекомых, регуляторов роста растений или стимуляторов роста растений.

[0015] В одном варианте осуществления изобретения, агрохимически активные вещества представляют собой один или более фунгицидов.

[0016] В некоторых аспектах, один или более фунгицидов представляют собой ингибиторы дыхательной цепи в комплексе I или II, выбранные из группы, состоящей из бензовиндифлупира, бикафена, боскалида, карбоксина, флуопирама, флутоланила, флуксапироксада, фураметпира, Изофетамида, изопиразама (анти-эпимерный энантиомер 1R,4S,9S), изопиразама (анти-эпимерный энантиомер 1S,4R,9R), изопиразама (анти-эпимерного рацемата 1RS,4SR,9SR), изопиразама (смеси син-эпимерного рацемата 1RS,4SR,9RS и анти-эпимерного рацемата 1RS,4SR,9SR), изопиразама (син-эпимерного энантиомера 1R,4S,9R), изопиразама (син-эпимерного энантиомера 1S,4R,9S), изопиразама (син-эпимерного рацемата 1RS,4SR,9RS), пенфлуфена, пентиопирада, пирифлуметофена, Пиразифлумида, седаксана, 1,3-диметил-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)-1H-пиразол-4-карбоксамид, 1,3-диметил-N-[(3R)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, 1,3-диметил-N-[(3S)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, 1-метил-3-(трифторметил)-N-[2'-(трифторметил)бифенил-2-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, 2-фтор-6-(трифторметил)-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)бензамида, 3-(дифторметил)-1-метил-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)-1H-пиразол-4-карбоксамид, 3-(дифторметил)-1-метил-N-[(3R)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, 3-(дифторметил)-1-метил-N-[(3S)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, Флуиндапира, 3-(дифторметил)-N-[(3R)-7-фтор-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, 3-

(дифторметил)-N-[(3S)-7-фтор-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, 5,8-дифтор-N-[2-(2-фтор-4-{[4-(трифторметил)пиридин-2-ил]окси}фенил)этил]хиназолин-4-амин, N-(2-циклопропил-5-фторбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-(2-трет-бутил-5-метилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-(2-трет-бутилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-(5-хлор-2-этилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-(5-хлор-2-изопропилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-[(1R,4S)-9-(дихлорметилен)-1,2,3,4-тетрагидро-1,4-метаннафтален-5-ил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-[(1S,4R)-9-(дихлорметилен)-1,2,3,4-тетрагидро-1,4-метаннафтален-5-ил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-[1-(2,4-дихлорфенил)-1-метоксипропан-2-ил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-[2-хлор-6-(трифторметил)бензил]-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-[3-хлор-2-фтор-6-(трифторметил)бензил]-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-[5-хлор-2-(трифторметил)бензил]-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-N-[5-метил-2-(трифторметил)бензил]-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-фтор-6-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропил-5-метилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксоамида, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(5-фтор-2-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-циклопропил-3-(дифторметил)-N-(2-этил-4,5-диметилбензил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-циклопропил-3-(дифторметил)-N-(2-этил-5-фторбензил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-циклопропил-3-(дифторметил)-N-(2-этил-5-метилбензил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-циклопропил-N-(2-циклопропил-5-фторбензил)-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-циклопропил-N-(2-

циклопропил-5-метилбензил)-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-N-(2-циклопропилбензил)-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоксамид и пирапропоина. В одном варианте осуществления изобретения, ингибитор дыхательной цепи в комплексе I или II представляет собой пенфлуфен.

[0017] В других вариантах осуществления изобретения, циклодекстриновое соединение образует комплекс включения с триазольным фунгицидом и/или одним или юлее агрохимически активных веществ. В некоторых аспектах, комплекс включения образуют путем растворения циклодекстринового соединения с триазольным фунгицидом и/или одним или более дополнительных агрохимически активных веществ в растворителе. В некоторых вариантах осуществления изобретения, растворитель затем удаляют путем выпаривания. Растворители, пригодные для этой цели, включают, но не ограничиваются ими, уксусную кислоту, ацетон, ацетонитрил, бензол, 1-бутанол, 2-бутанол, 2-бутанон, трет-бутиловый спирт, тетрахлорид углерода, хлорбензол, хлороформ, циклогексан, 1,2-дихлорэтан, диэтиленгиколь, диэтиловый эфир, диглим (простой диметиловый эфир диэтиленгликоля), 1,2-диметоксиэтан (глим, DME), диметилформамид (DMF), диметилсульфоксид (DMSO), 1,4-диоксан, этанол, этилацетат, этиленгликоль, глицерин, гептан, гексаметилфосфорамид (HMPA), гексаметилфосфорный триамид (HMPT), гексан, метанол, метилтретбутиловый эфир (MTBE), метиленхлорид, N-метил-2-пирролидинон (NMP), нитрометан, пентан, Петролейный эфир (лигроин), 1-пропанол, 2-пропанол, пиридин, тетрагидрофуран (THF), толуол, триэтиламин, воду, о-ксилен, m-ксилен и p-ксилен. В одном варианте осуществления изобретения, растворитель представляет собой этанол.

[0018] В других вариантах осуществления, жидкая препаративная форма содержит триазольный и/или пиразольный фунгицид в концентрации от около 0.1% до около 10% (мас./мас.); и, по меньшей мере, одно циклодекстриновое соединение в концентрации от около 1% до около 50% (мас./мас.).

[0019] В некоторых аспектах, триазольный и/или пиразольный фунгицид находится в концентрации от около 0.1% до около 10% (мас./мас.), от около 0.1% до около 7.5% (мас./мас.), от около 0.1% до около 5% (мас./мас.), или от около 0.1% до около 2.5% (мас./мас.). В одном аспекте, триазольный или пиразольный фунгицид находится в концентрации от около 0.1% до около 2.5% (мас./мас.).

[0020] В других аспектах, по меньшей мере, одно циклодекстриновое соединение находится в концентрации от около 1% до около 50% (мас./мас.), от около 1% до около 40% (мас./мас.), от около 1% до около 30% (мас./мас.), от около 1% до около 40% (мас./мас.), или от около 1% до около 20% (мас./мас.). В одном аспекте, по меньшей мере, одно циклодекстриновое соединение находится в концентрации от около 1% до около 20% (мас./мас.).

[0021] В еще одних аспектах, молярное соотношение триазольного и/или пиразольного фунгицида и циклодекстринового соединения находится в диапазоне от около 1:1 до около 1:25, от около 1:1 до около 1:20, от около 1:1 до около 1:15, от около 1:1 до около 1:10, или от около 1:1 до около 1:5. В одном аспекте, молярное соотношение триазольного фунгицида и циклодекстринового соединения находится в диапазоне от около 1:1 до около 1:15.

[0022] В некоторых аспектах, молярное соотношение триазольного и/или пиразольного фунгицида и циклодекстринового соединения составляет около 1:25, около 1:20, около 1:15, около 1:10, около 1:5, или около 1:1. В одном аспекте, молярное соотношение триазольного и/или пиразольного фунгицида и циклодекстринового соединения составляет около 1:10.

[0023] В одном аспекте настоящее изобретение относится к способу получения жидкой препаративной формы путем смешивания триазольного и/или пиразольного фунгицида, по меньшей мере, одного циклодекстринового соединения, агрохимически активных веществ и, при необходимости, других добавок.

[0024] В некоторых аспектах, настоящее изобретение относится к способу подавления деградации триазольного и/или пиразольного фунгицида в жидкой препаративной форме, включающему: (а) упаковку препаративной формы в подходящий контейнер; (b) уменьшение воздействия кислорода на триазольный и/или пиразольный фунгицид в препаративной форме по сравнению с воздействием кислорода на триазольный и/или пиразольный фунгицид, когда препаративная форма контактирует с воздухом; и (с) закрытие или герметизацию контейнера.

[0025] В некоторых вариантах осуществления изобретения контейнер содержит мало свободного пространства или не содержит совсем. В других вариантах осуществления изобретения контейнер способствует уменьшению или предотвращению диффузии кислорода.

[0026] В некоторых аспектах, воздействие кислорода на этапе (b) уменьшают за счет продувки свободного пространства и/или препаративной формы газом, содержащим меньше кислорода по сравнению с воздухом или не содержащим кислорода. Газ может представлять собой водород, азот, гелий, неон, аргон, криптон, ксенон, радон, диоксид углерода, оксид азота, сероводород, низший алкан, галогеналкан, алкоксиалкан или их смесь. В одном аспекте, газ представляет собой азот.

[0027] В других вариантах осуществления изобретения настоящее изобретение относится к закрытому контейнеру, содержащему внутри жидкую препаративную форму, содержащую триазольный и/или пиразольный фунгицид, при этом с помощью описанных способов воздействие кислорода на триазольный и/или пиразольный фунгицид в препаративной форме уменьшено по сравнению с воздействием кислорода на триазольный и/или пиразольный фунгицид, если препаративная форма контактирует с воздухом.

[0028] В других вариантах осуществления, настоящее изобретение относится к способу борьбы с вредителями растений или с фитопатогенными грибами, включающему получение жидкой препаративной формы или контейнера, содержащего жидкую препаративную форму в соответствии с описанием в настоящем документе; получение препаративной формы для сельскохозяйственного применения или для применения в качестве биоцида; и нанесение полученной препаративной формы на растение или место произрастания, нуждающееся в таком нанесении.

[0029] В одном варианте осуществления настоящее изобретение относится к жидкой препаративной форме, содержащей триазольный и/или пиразольный фунгицид и соединение циклодекстрина в соответствии с описанием в настоящем документе, при этом осуществляют подавление триазольного и/или пиразольного фунгицида в жидкой препаративной форме в соответствии со способами, описанными в настоящем документе. При наличии циклодекстринового соединения в жидкой препаративной форме и при уменьшении воздействия кислорода в соответствии с описанием может быть получен синергетический комбинированный эффект на стабилизацию триазольного и/или пиразольного фунгицида.

КРАТКОЕ ОПИСАНИЕ ЧЕРТЕЖЕЙ

[0030] НА ФИГ. 1А показана деградация протиоконазола в водном растворе в концентрации приблизительно 1% - 1,5% (мас./мас.) после хранения в течение двух недель при 54 °С, в течение восьми недель при 40 °С или в течение 52 недель при 20 °С. НА ФИГ. 1В показана деградация протиоконазола после хранения в течение двух недель при 54 °С в водном растворе в концентрации приблизительно 1% - 1,5% (мас./мас.) без циклодекстринов («контрольный ПТЗ») или в смеси с 15% (мас./мас.) 2-гидроксипропил-β циклодекстрина («PTZ + 15% HPCD») или с 15% (мас./мас.) метил-β циклодекстрина («PTZ + 15% MeCD»).

[0031] НА ФИГ. 2 показаны профили дифференциальной сканирующей калориметрии (ДСК) (1) PTZ; (2) HPCD; (3) физической смеси протиоконазола и HPCD; и (4) комплекса включения протиоконазола и HPCD.

[0032] НА ФИГ. 3 показана стабилизация смесей протиоконазола с увеличивающимися количествами циклодекстрина от 10 до 50 мас.%.

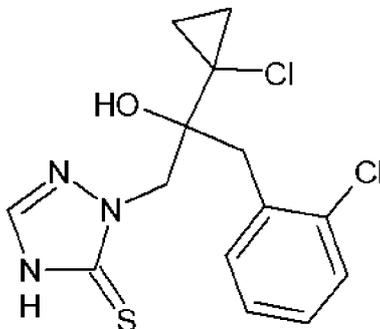
[0033] НА ФИГ. 4 показана стабилизация смесей пенфлуфена с увеличивающимися количествами циклодекстрина от 10 до 50 мас.%.

ПОДРОБНОЕ ОПИСАНИЕ

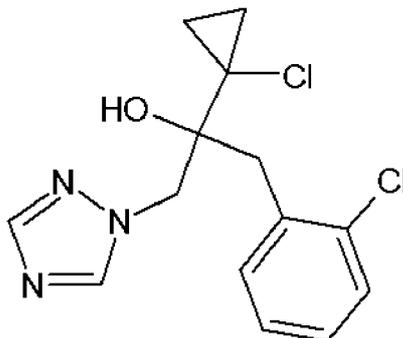
[0034] В контексте настоящего документа в описании и в формуле изобретения глагол «содержать» и его формы не имеют ограничительного характера; это подразумевает то, что перечисленные наименования включены в указанную группу, при этом указанная группа также может включать иные наименования, которые не были прямо упомянуты. Кроме того, при упоминании по тексту настоящего документа какого-либо элемента в единственном числе подразумевается также, что может присутствовать несколько таких элементов, за исключением случаев, когда из контекста очевидно следует, что присутствует лишь один такой элемент. Таким образом, например, использование термина в единственном числе означает «по меньшей мере, один X».

[0035] Следует понимать, что любой числовой диапазон, приведенный в данном документе, включает все входящие в него поддиапазоны. Например, диапазон от 1 до 10 включает все поддиапазоны между указанным минимальным значением 1 и указанным максимальным значением 10 включительно, то есть такой поддиапазон имеет минимальное значение, равное или превышающее 1, и максимальное значение равное или менее 10.

[0036] В контексте настоящего документа термин «протиоконазол» относится к химическому соединению 2-[2-(1-хлороциклопропил)-3-(2-хлорофенил)-2-гидрокси-пропил]-2,4-дигидро-3Н-1,2,4-триазол-3-тиона со следующей формулой:

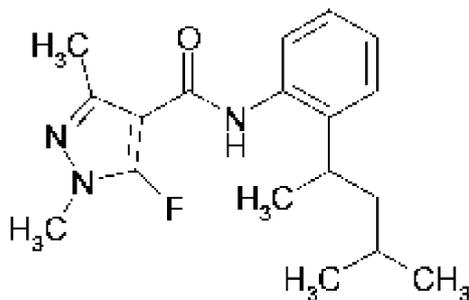


[0037] В контексте настоящего документа, термин “протиоконазол дестио” относится к химическому соединению 2-(1-хлороциклопропил)-1-(2-хлорфенил)-3-(1Н-1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-олу (CAS № 178928-70-6), имеющему следующую формулу:



Протиоконазол содержится в виде рацемата.

[0038] В контексте настоящего документа термин “пенфлуфен” относится к химическому соединению N-[2-(1,3-диметилбутил)фенил]-5-фтор-1,3-диметилпиразол-4-карбоксамиду, имеющему следующую формулу:



[0039] Препаративные формы и способы, описанные в настоящем документе, обеспечивают химически стабильную и/или физически стабильную форму триазольного и/или пиразольного фунгицида, в частности, протиоконазола.

[0040] В контексте настоящего изобретения выражение «химически стабильный» означает дисперсию, содержащую один или более активных ингредиентов, где активный ингредиент не разлагается химически или не происходит химическая деградация АИ до неприемлемой степени; например, количество активного ингредиента не уменьшается более чем на 10 массовых процентов, предпочтительно на 5 массовых процентов, по сравнению с его исходной концентрацией после хранения дисперсии при 54 °С в течение четырех недель.

[0041] В контексте настоящего изобретения выражение «физически стабильный» означает дисперсию, содержащую активный ингредиент, в которой дисперсная фаза не осаждается или легко повторно диспергируется, если происходит некоторое осаждение, две фазы распределены более однородно по всей дисперсии, и/или дисперсия демонстрирует меньший синерезис, чем нестабильная дисперсия.

[0042] В патенте США № 5,789,430 описано получение из производных триазолила нескольких сельскохозяйственных микробиоцидов, таких как протиоконазол.

[0043] В контексте настоящего изобретения триазольный фунгицид может быть выбран из группы, состоящей из азаконазола (3.1), битертанола (3.2), бромуконазола (3.3), ципроконазола (3.4), диклобутразола (3.5), дифеноконазола (3.6), диниконазола (3.7), диниконазола-М (3.8), эпоксиконазола (3.9), этаконазола (3.10), фенбуконазола (3.11), флухинконазола (3.12), флусилазола (3.13), флутриафола (3.14), фурконазола (3.15), фурконазола-цис (3.16), гексаконазола (3.17), имибенконазола (3.18), ипконазола (3.19), метконазола (3.20), миклбутанила (3.21), паклобутразола (3.22), пенконазола (3.23), пропиконазола (3.24), протиоконазола (3.25), хинконазола (3.26), симеконазола (3.27), тебуконазола (3.28), тетраконазола (3.29), триадимефона (3.30), триадименола (3.31), тритиконазола (3.32), униконазола (3.33), униконазола-Р (3.34), вориконазола (3.35), и 1-(4-хлорфенил)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)циклопентанола (3.36).

[0044] Предпочтительно, триазольный фунгицид выбран из группы, состоящей из эпоксиконазола (3.9), протиоконазола (3.25) и тебуконазола (3.28). Более предпочтительно, триазольный фунгицид выбран из группы, состоящей из протиоконазола (3.25) и тебуконазола (3.28). Наиболее предпочтительно триазольный фунгицид представляет собой протиоконазол (3.25).

[0045] В контексте настоящего изобретения пиразольный фунгицид может быть выбран из группы, состоящей из бензовиндифлупира, биксафена, флуиндапира, флуксапироксада, фураметпира, изопиразама, пенфлуфена, пентиопирада, пирифлуметофена, пирапропоина, рабензазола и седаксана. Предпочтительно, пиразольный фунгицид представляет собой пенфлуфен.

[0046] В контексте настоящего изобретения циклодекстриновое соединение может представлять собой α -циклодекстрин, β -циклодекстрин или γ -циклодекстрин. Циклодекстриновое соединение может быть модифицировано, например, с использованием одной или более замен в гидроксильной группе, например, замен в одной или более группах 2-гидроксила, группах 3-гидроксила и группах 6-гидроксила любого мономера глюкозы циклодекстрина. Подходящие замены могут включать, помимо прочего, замены алкильной группы (например, замены метилом), замены гидроксильной группы, замены алкоксиалкильной группы, замены сульфоалкильной группы, замены сульфоалкилэфирной группы, замены группы алкиламмония, замены нитрильной группы, замены фосфиновой группы и замены группы сахара. Модифицированные циклодекстрины могут включать, помимо прочего, метилциклодекстрины (например, метил β -циклодекстрин), гидроксиэтил циклодекстрины, например, гидроксиэтил β -циклодекстрин) 2-гидроксипропил циклодекстрины (например, 2-гидроксипропил β -циклодекстрин и 2-гидроксипропил γ -циклодекстрин), сульфобутил циклодекстрины, глюкозил циклодекстрины (например, глюкозил α -циклодекстрин и глюкозил β -циклодекстрин), мальтозил циклодекстрины (например, мальтозил α -циклодекстрин и мальтозил β -циклодекстрин) и сульфоалкилэфир циклодекстрины (например, сульфоэтиловый эфир β -циклодекстрин, сульфопропиловый эфир β -циклодекстрин и сульфобутилэфир β -циклодекстрин).

[0047] В патентах США №№ 5,134,127 и 5,376,645, (Stella et al.) описаны производные сульфоалкилэфирциклодекстрина и их применение в качестве сольбилизирующих агентов для нерастворимых в воде активных соединений. В

документах Stella et al. описан комплекс включения нерастворимого в воде активного соединения и производного сульфоалкилэфирциклодекстрина и композиции, содержащие эти комплексы включения. Примеры производных сульфоалкилэфирциклодекстрина включают моносульфобутилэфиры β -циклодекстрина и моносульфопропилэфиры β -циклодекстрина.

[0048] В некоторых аспектах, циклодекстриновое соединение может быть выбрано из группы, состоящей из γ -циклодекстрина (4.1), α -циклодекстрина (4.2), β -циклодекстрина (4.3), глюкозил- α -циклодекстрин (4.4), мальтозил- α -циклодекстрина (4.5), глюкозил- β -циклодекстрина (4.6), мальтозил- β -циклодекстрина (4.7), 2-гидрокси- β -циклодекстрина (4.8), 2-гидроксипропил- β -циклодекстрина (HP β CD) (4.9), 2-гидроксипропил- γ -циклодекстрина (4.10), гидроксиэтил- β -циклодекстрина (4.11), метил- β -циклодекстрина (4.12), сульфобутиловый эфир- α -циклодекстрина (4.13), сульфобутиловый эфир- β -циклодекстрина (4.14) и сульфобутиловый эфир- γ -циклодекстрина (4.15), диметил- β -циклодекстрина (DM β CD) (4.16), триметил- β -циклодекстрина (TM β CD) (4.17), произвольно метилированного- β -циклодекстрина (RM β CD) (4.18), гидроксиэтил- β -циклодекстрина (HE β CD) (4.19), 3-гидроксипропил- β -циклодекстрина (3HP β CD) (4.20), 2,3-дигидроксипропил- β -циклодекстрина (DHP β CD) (4.21), 2-гидроксиизобутил- β -циклодекстрина (HIB β CD) (4.22), сульфобутиловый эфир- β -циклодекстрина (SBE β CD) (4.23), глюкозил- β -циклодекстрина (G1 β CD) (4.24), мальтозил- β -циклодекстрина (G2 β CD) (4.25), сульфозетиловый эфир- β -циклодекстрина (4.26) и сульфопропиловый эфир- β -циклодекстрина (4.27).

[0049] Предпочтительно, циклодекстриновое соединение выбрано из группы, состоящей из β -циклодекстрина (4.3), 2-гидроксипропил- β -циклодекстрина (4.9), 2-гидроксипропил- γ -циклодекстрина (4.10), метил- β -циклодекстрина (4.12), сульфобутиловый эфир- α -циклодекстрина (4.13), сульфобутиловый эфир- β -циклодекстрина (4.14) и сульфобутиловый эфир- γ -циклодекстрина (4.15), диметил- β -циклодекстрина (DM β CD) (4.16), триметил- β -циклодекстрина (TM β CD) (4.17), произвольно метилированного- β -циклодекстрина (RM β CD) (4.18), 3-гидроксипропил- β -циклодекстрина (3HP β CD) (4.20), 2,3-дигидроксипропил- β -циклодекстрина (DHP β CD) (4.21), сульфозетиловый эфир- β -циклодекстрина (4.26) и сульфопропиловый эфир- β -циклодекстрина (4.27).

[0050] Более предпочтительно, циклодекстриновое соединение выбрано из группы, состоящей из β -циклодекстрина (4.3), 2-гидроксипропил- β -

циклодекстрина (4.9), метил- β -циклодекстрина (4.12), и 3-гидроксипропил- β -циклодекстрина (ЗНР β CD) (4.20). Наиболее предпочтительные циклодекстриновые соединения представляют собой 2-гидроксипропил- β -циклодекстрин (4.9) и метил- β -циклодекстрин (4.12).

[0051] Предпочтение отдается следующим соединениям: (3.9) + (4.1), (3.9) + (4.2), (3.9) + (4.3), (3.9) + (4.4), (3.9) + (4.5), (3.9) + (4.6), (3.9) + (4.7), (3.9) + (4.8), (3.9) + (4.9), (3.9) + (4.10), (3.9) + (4.11), (3.9) + (4.12), (3.9) + (4.13), (3.9) + (4.14), (3.9) + (4.15), (3.9) + (4.16), (3.9) + (4.17), (3.9) + (4.18), (3.9) + (4.19), (3.9) + (4.20), (3.9) + (4.21), (3.9) + (4.22), (3.9) + (4.23), (3.9) + (4.24), (3.9) + (4.25), (3.9) + (4.26), (3.9) + (4.27), (3.25) + (4.1), (3.25) + (4.2), (3.25) + (4.3), (3.25) + (4.4), (3.25) + (4.5), (3.25) + (4.6), (3.25) + (4.7), (3.25) + (4.8), (3.25) + (4.9), (3.25) + (4.10), (3.25) + (4.11), (3.25) + (4.12), (3.25) + (4.13), (3.25) + (4.14), (3.25) + (4.15), (3.25) + (4.16), (3.25) + (4.17), (3.25) + (4.18), (3.25) + (4.19), (3.25) + (4.20), (3.25) + (4.21), (3.25) + (4.22), (3.25) + (4.23), (3.25) + (4.24), (3.25) + (4.25), (3.25) + (4.26), (3.25) + (4.27), (3.28) + (4.1), (3.28) + (4.2), (3.28) + (4.3), (3.28) + (4.4), (3.28) + (4.5), (3.28) + (4.6), (3.28) + (4.7), (3.28) + (4.8), (3.28) + (4.9), (3.28) + (4.10), (3.28) + (4.11), (3.28) + (4.12), (3.28) + (4.13), (3.28) + (4.14), (3.28) + (4.15), (3.28) + (4.16), (3.28) + (4.17), (3.28) + (4.18), (3.28) + (4.19), (3.28) + (4.20), (3.28) + (4.21), (3.28) + (4.22), (3.28) + (4.23), (3.28) + (4.24), (3.28) + (4.25), (3.28) + (4.26), (3.28) + (4.27).

[0052] Из указанных соединений следующие соединения являются еще более предпочтительными: (3.9) + (4.3), (3.9) + (4.9), (3.9) + (4.10), (3.9) + (4.12), (3.9) + (4.13), (3.9) + (4.14), (3.9) + (4.15), (3.9) + (4.16), (3.9) + (4.17), (3.9) + (4.18), (3.9) + (4.20), (3.9) + (4.21), (3.9) + (4.26), (3.9) + (4.27), (3.25) + (4.3), (3.25) + (4.9), (3.25) + (4.10), (3.25) + (4.12), (3.25) + (4.13), (3.25) + (4.14), (3.25) + (4.15), (3.25) + (4.16), (3.25) + (4.17), (3.25) + (4.18), (3.25) + (4.20), (3.25) + (4.21), (3.25) + (4.26), (3.25) + (4.27), (3.28) + (4.3), (3.28) + (4.9), (3.28) + (4.10), (3.28) + (4.12), (3.28) + (4.13), (3.28) + (4.14), (3.28) + (4.15), (3.28) + (4.16), (3.28) + (4.17), (3.28) + (4.18), (3.28) + (4.20), (3.28) + (4.21), (3.28) + (4.26), (3.28) + (4.27).

[0053] Из указанных соединений следующие соединения являются еще более предпочтительными: (3.9) + (4.3), (3.9) + (4.9), (3.9) + (4.12), (3.9) + (4.20), (3.25) + (4.3), (3.25) + (4.9), (3.25) + (4.12), (3.25) + (4.20), (3.28) + (4.3), (3.28) + (4.9), (3.28) + (4.12), (3.28) + (4.20).

[0054] Предпочтение отдается следующим соединениям: (3.25) + (4.1), (3.25) + (4.2), (3.25) + (4.3), (3.25) + (4.4), (3.25) + (4.5), (3.25) + (4.6), (3.25) + (4.7),

(3.25) + (4.8), (3.25) + (4.9), (3.25) + (4.10), (3.25) + (4.11), (3.25) + (4.12), (3.25) + (4.13), (3.25) + (4.14), (3.25) + (4.15), (3.25) + (4.16), (3.25) + (4.17), (3.25) + (4.18), (3.25) + (4.19), (3.25) + (4.20), (3.25) + (4.21), (3.25) + (4.22), (3.25) + (4.23), (3.25) + (4.24), (3.25) + (4.25), (3.25) + (4.26), (3.25) + (4.27).

[0055] Из указанных соединений следующие соединения являются еще более предпочтительными: (3.25) + (4.3), (3.25) + (4.9), (3.25) + (4.10), (3.25) + (4.12), (3.25) + (4.16), (3.25) + (4.17), (3.25) + (4.18), (3.25) + (4.20), (3.25) + (4.21).

[0056] Из указанных соединений следующие соединения являются еще более предпочтительными: (3.25) + (4.3), (3.25) + (4.9), (3.25) + (4.12), (3.25) + (4.20).

[0057] В некоторых вариантах осуществления изобретения, триазольный фунгицид представляет собой протиоконазол, и циклодекстриновое соединение представляет собой 2-гидроксипропил- β -циклодекстрин или метил- β -циклодекстрин.

[0058] В других вариантах осуществления изобретения, пиразольный фунгицид представляет собой пенфлуфен, и циклодекстриновое соединение представляет собой 2-гидроксипропил- β -циклодекстрин или метил- β -циклодекстрин.

[0059] В других вариантах осуществления, фунгицид представляет собой смесь протиоконазола и пенфлуфена, и циклодекстриновое соединение представляет собой 2-гидроксипропил- β -циклодекстрин или метил- β -циклодекстрин.

[0060] Препаративная форма в соответствии с изобретением представляет собой жидкую препаративную форму. Такие препаративные формы включают следующие типы: DC (диспергируемый концентрат), EC (концентрат эмульсии), EW (эмульсия типа «масло-в-воде»), ES (эмульсионный краситель), FS (многофазный концентрат для обработки семян), ЭО (эмульсия типа «вода в масле»), ME (микроэмульсия), SE (суспозэмульсия), SL (водорастворимый концентрат), CS (капсульная суспензия) и AL (готовый к использованию жидкую препаративную форму, другие жидкости для неразбавленного использования).

[0061] При необходимости, препаративная форма по изобретению может содержать другие добавки, такие как катионные эмульгаторы, пеногасители, загустители, диспергаторы, стабилизаторы, адьюванты, консерванты, полимеры, кислоты и основания, красители, антифризы, биоциды, наполнители и воду. В

контексте настоящего документа адъювант – это компонент, который усиливает биологический эффект препаративной формы, но сам компонент не имеет биологического действия.

[0062] Жидкая препаративная форма или водная дисперсия по настоящему изобретению, при необходимости, может включать вспомогательные известные специалистам агенты, обычно используемые в препаративных формах для обработки сельскохозяйственных культур. Примеры включают антиоксиданты, например, аскорбиновую кислоту, пенетранты, биоциды, консерванты, дезодоранты, ароматизаторы, добавки, предохраняющие от замерзания, и ингибиторы испарения, например, глицерин и этилен или пропиленгликоль, сорбит, минеральное масло, технологические масла, лактат натрия, наполнители, носители, окрашивающие вещества, включая пигменты и/или красители, модификаторы pH (буферы, кислоты и основания), соли, например хлориды кальция, магния, аммония, калия, натрия и/или железа, удобрения, например, сульфат аммония и нитрат аммония, мочевины и поверхностно-активные вещества, например, диспергирующие агенты, эмульгаторы, смачиватели, пеногасители и суспендирующие вещества. Жидкая препаративная форма или водная дисперсия может также содержать другие активные ингредиенты, такие как дополнительные фунгициды, инсектициды, пестициды и/или удобрения, известные специалистам, при условии, что они совместимы с протиоконазолом.

[0063] Предпочтительными дополнительными инсектицидными компонентами являются, например, имидаклоприд, нитенпирам, ацетамиприд, тиаклоприд, тиаметоксам, клотианидин, циантранилипрол, хлорантранилипрол, флубендиамид, тетранилипрол, цикланилипрол, спиродиклофен, спиромезифен, спиротетрамат, абамектин, акринатрин, хлорфенапир, эмаектин, этипрол, фипронил, флониамид, флупирадифурон, индоксакарб, метафлумизон, метоксифенозид, милбемицин, пиридабен, пиридалил, силафлуофен, спиносад, сульфоксумафлор и трифлуксумафлор.

[0064] Предпочтительными дополнительными фунгицидными компонентами являются, например, биксафен, фенамидон, фенгексамид, флуопиколид, флуопирам, флуоксастробин, ипроваликарб, изотианил, изопиразам, пенцикурон, пенфлуфен, пропинеб, тебуконазол, трифлуксистробин, аметоктрадин, амисульбром, азоксистробин, бентиаваликарбисопропил, бензовиндифлупир, боскалид, карбендазим, хлоротанонил, циазофамид,

цифлуфенамид, цимоксанил, ципроконазол, дифеноконазол, этабоксам, эпоксиконазол, фамоксадон, флуазилам, флухинконазол, флусилазол, флутанил, флуксапироксад, изопиразам, крезоксим-метил, манкоцеб, мандипропамид, метконазол, пириофенон, фолпет, метаминостробин, оксатиапипролин, пентиопирад, пикоксистробин, проквиназид, пирифлуметофен, пиракlostробин, седаксан, спироksamин, тебуфлокин, тетраконазол, валифеналат, зоксамид, зирам, N-(5-хлор-2-изопропилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-(5-хлор-2-изопропилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, 2-{3-[2-(1-{[3,5-бис(дифторметил)-1H-пиразол-1-ил]-ацетил}-пиперидин-4-ил)1,3-тиазол-4-ил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-5-ил} фенил метансульфонат, 2-{3-[2-(1-{[3,5-бис(дифторметил)-1H-пиразол-1-ил] ацетил} пиперидин-4-ил)-1,3-тиазол-4-ил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-5-ил-3-хлорфенилметан сульфонат, (3S, 6S, 7R, 8R)-8-бензил-3-[(3-[(изобутирилокси)метокси]-4-метоксипиридин-2-ил} карбонил)амино]-6-метил-4,9-диоксо-1,5-диоксонан-7-ил 2-метилпропаноат (лизерфенилвалпир).

[0065] Особенно предпочтительными дополнительными фунгицидными компонентами являются, например: тебуконазол, спироksamин, биксафен, флуоксастробин, трифлуксистробин, N-(5-хлор-2-изопропилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил 1H-пиразол-4-карбоксамид, (3S, 6S, 7R, 8R)-8-бензил-3-[(3-[(изобутирилокси)метокси]-4-метоксипиридин-2-ил} карбонил)амино]-6-метил-4,9-диоксо-1,5-диоксонан-7-ил-2-метилпропаноат (лизерфенилвалпир) и флуопирам.

[0066] В некоторых вариантах осуществления изобретения дополнительный фунгицидный компонент представляет собой ингибитор дыхательной цепи в комплексе I или II. Такие ингибиторы дыхательной цепи в комплексе I или II включают, но не ограничиваются ими, бензовиндифлупир, биксафен, боскалид, карбоксин, флуопирам, флутоланил, флуксапироксад, фураметпир, Изофетамид, изопиразам (анти-эпимерный энантиомер 1R,4S,9S), изопиразам (анти-эпимерный энантиомер 1S,4R,9R), изопиразам (анти-эпимерный рацемат 1RS,4SR,9SR), изопиразам (смесь син-эпимерного рацемата 1RS,4SR,9RS и анти-эпимерный рацемат 1RS,4SR,9SR), изопиразам (син-эпимерный энантиомер 1R,4S,9R), изопиразам (син-эпимерный энантиомер 1S,4R,9S), изопиразам (син-эпимерный рацемат 1RS,4SR,9RS), пенфлуфен, пентиопирад, пирифлуметофен,

Пиразифлумид, седаксан, 1,3-диметил-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)-1H-пиразол-4-карбоксамид, 1,3-диметил-N-[(3R)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, 1,3-диметил-N-[(3S)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, 1-метил-3-(трифторметил)-N-[2'-(трифторметил)бифенил-2-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, 2-фтор-6-(трифторметил)-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)бензамид, 3-(дифторметил)-1-метил-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)-1H-пиразол-4-карбоксамид, 3-(дифторметил)-1-метил-N-[(3R)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, 3-(дифторметил)-1-метил-N-[(3S)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, Флуиндапир, 3-(дифторметил)-N-[(3R)-7-фтор-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, 3-(дифторметил)-N-[(3S)-7-фтор-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, 5,8-дифтор-N-[2-(2-фтор-4-{[4-(трифторметил)пиридин-2-ил]окси}фенил)этил]хиназолин-4-амин, N-(2-циклопентил-5-фторбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-(2-трет-бутил-5-метилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-(2-трет-бутилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-(5-хлор-2-этилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-(5-хлор-2-изопропилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-[(1R,4S)-9-(дихлорметилен)-1,2,3,4-тетрагидро-1,4-метаннафтален-5-ил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-[(1S,4R)-9-(дихлорметилен)-1,2,3,4-тетрагидро-1,4-метаннафтален-5-ил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-[1-(2,4-дихлорфенил)-1-метоксипропан-2-ил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-[2-хлор-6-(трифторметил)бензил]-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-[3-хлор-2-фтор-6-(трифторметил)бензил]-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-[5-хлор-2-(трифторметил)бензил]-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-N-[5-метил-2-(трифторметил)бензил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-фтор-6-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-

карбоксамид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропил-5-метилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карботиоамид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(5-фтор-2-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-N-(2-этил-4,5-диметилбензил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-N-(2-этил-5-фторбензил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-N-(2-циклопропил-5-фторбензил)-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-N-(2-циклопропил-5-метилбензил)-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-N-(2-циклопропилбензил)-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид и пирпропоин. В одном варианте осуществления изобретения ингибитор дыхательной цепи в комплексе I или II представляет собой пенфлуфен или флуопирам. В другом варианте осуществления изобретения ингибитор дыхательной цепи в комплексе I или II представляет собой пенфлуфен.

[0067] Другими добавками, которые, при необходимости, содержатся в препаративной форме по изобретению, являются средства, улучшающие проникновение, увлажняющие реагенты, лиофилизирующие агенты, пеногасители и/или удерживающие добавки.

[0068] Пригодные пеногасители включают все обычные пеногасители, включая пеногасители на основе силикона и перфторалкилфосфиновые и фосфиновые кислоты, в частности, пеногасители на основе силикона, такие как, например, силиконовые масла. В некоторых вариантах осуществления изобретения, пеногасители представляют собой силиконовые масла, препараты силиконового масла, стеарат магния, фосфиновые и/или фосфиновые кислоты. Примерами являются SILCOLAPSE[®] 482 от Bluestar Silicones, SILFOAM[®] SC1132 от Wacker [диметилсилоксаны и силиконы, № CAS 63148-62-9], SAG 1538 или SAG 1572 от Momentive [диметилсилоксаны и силиконы, № CAS 63148-62-9] или FLUOWET[®] PL 80.

[0069] Чаще всего используют пеногасители из группы линейных полидиметилсилоксанов, средняя динамическая вязкость которых при 25 °C

находится в диапазоне 1000 - 8000 мПа·с (миллипаскаль-секунд), как правило, в диапазоне 1200 - 6000 мПа·с, и содержащие диоксид кремния. Диоксид кремния включает поликремниевую кислоту, метакремниевую кислоту, орто-кремниевую кислоту, силикагель, гели кремниевой кислоты, кизельгур, осажденный SiO₂ и другие подобные соединения.

[0070] Пенегасители из группы линейных полидиметилсилоксанов содержат в качестве своей химической основы соединение формулы HO—[Si(CH₃)₂—O—]_n—H, в котором концевые группы модифицированы, например, этерификацией или присоединены к группам —Si(CH₃)₃. Неограничивающими примерами пенегасителей этого типа являются RHODORSIL[®] Antifoam 416 (Rhodia) и RHODORSIL[®] Antifoam 481 (Rhodia). Другими подходящими пенегасителями являются RHODORSIL[®] 1824, ANTIMUSSOL 4459-2 (Clariant), Defoamer V 4459 (Clariant), SE Visk и AS EM SE 39 (Wacker). Силиконовые масла также могут быть использованы в виде эмульсий.

[0071] Дополнительные подходящие добавки, которые в некоторых случаях могут присутствовать в препаративной форме по изобретению, включают консерванты, антиоксиданты, красители и инертные наполнители.

[0072] Возможными консервантами являются все вещества, которые обычно для этой цели могут быть использованы с агрохимикатами. Подходящими консервантами являются, например, препараты с 5-хлор-2-метил-4-изотиазолин-3-оном [CIT; № CAS 26172-55-4], 2-метил-4-изотиазолин-3-оном [MIT, № CAS 2682-20-4] или 1,2-бензизотиазол-3(2H)-оном [BIT, № CAS 2634-33-5]. Примеры включают PREVENTOL[®] D7 (Lanxess), KATHON[®] CG / ICP (Rohm & Haas), ACTICIDE[®] SPX (Thor GmbH) и PROXEL[®] GXL (Arch Chemicals).

[0073] В качестве антиоксидантов применимы все вещества, которые обычно могут быть использованы с агрохимикатами для этой цели. Предпочтение отдается бутилгидрокситолуолу [3,5-ди-трет-бутил-4-гидрокситолуолу, № CAS 128-37-0] и лимонной кислоте.

[0074] В качестве красителей могут быть использованы все вещества, которые обычно пригодны для использования с агрохимикатами для этой цели. Примеры включают диоксид титана, газовую сажу, оксид цинка, синие пигменты, красные пигменты и краситель Permanent Red FGR.

[0075] Подходящими инертными наполнителями являются все вещества, которые обычно могут быть использованы с агрохимикатами для этой цели и

которые не действуют как загустители. Предпочтительно используют неорганические частицы, такие как карбонаты, силикаты и оксиды, а также органические вещества, такие как конденсаты карбамида и формальдегида. Примеры включают каолин, рутил, диоксид кремния («коллоидный диоксид кремния»), силикагель и природные и синтетические силикаты, также называемые тальком.

[0076] В качестве контейнера может быть использован любой герметичный или, по меньшей мере, закрытый контейнер, при этом герметичные контейнеры являются предпочтительными. Контейнеры, пригодные для использования по настоящему изобретению, могут быть изготовлены из различных видов материалов, таких, например, как стекло, металл (например, алюминий и олово), пластик (например, термопласты, такие как HDPE (полиэтилен высокой плотности), PA (полиамид), EVOH (сополимер этилена и винилового спирта), PET (полиэтилентерефталат), PP (полипропилен), биополимеры, композитные материалы (такие как материалы на основе целлюлозы, такие как бумага, картон, гофрированная бумага, облицованная защитными материалами), защитные материалы, такие как Соех (HDPE/PA, HDPE/EVOH) для полых контейнеров, а также многослойные пленки и фольговые ламинаты (такие как PE, PET, PA, EVOH, LDPE (полиэтилен низкой плотности), PVC (поливинилхлорид), EVA (этиленвинилацетат) и OPP (ориентированный PP) или комбинации указанных соединений.

[0077] Контейнер, используемый в настоящем изобретении, может быть выполнен в виде различных изделий (например, в виде бутылки, пакета (пакета с устойчивым дном, горизонтального мешка из рукавной плёнки), банки и горшка) и иметь различные формы с герметизируемыми и негерметизируемыми закрывающими устройствами. Могут быть использованы закрывающие устройства разных типов, например, могут быть использованы воздухопроницаемые закрывающие устройства или воздухонепроницаемые или, более предпочтительно, герметичные закрывающие устройства. В некоторых случаях может быть предпочтительным, если закрывающее устройство является герметичным.

[0078] Могут быть использованы воздухопроницаемые закрывающие устройства в диапазоне от однослойных полимеров до многослойных композитов из бумаги, пленок, фольги и покрытий и включают пеноматериалы (например, на основе полиэтилена) и мембраны.

[0079] Воздухонепроницаемые закрывающие устройства включают вкладыши для индукционной запайки. Индукционная запайка, также известная как герметизация с помощью обжимного колпачка, представляет собой процесс бесконтактного нагрева, который обеспечивает герметизацию контейнера с помощью закрывающего устройства, включающего термосвариваемый фольговый ламинат. Обычно индукционная запайка начинается с размещения многослойного вкладыша внутри закрывающего устройства. Такой вкладыш состоит из слоя целлюлозного картона, слоя воска, алюминиевой фольги и слоя полимера, совместимого с материалом бутылки и способного привариваться к кромке контейнера. Этот процесс герметизации осуществляют, после того как контейнер заполнен и закрыт крышкой.

[0080] Термин «уменьшение воздействия кислорода» означает снижение содержания кислорода в атмосфере, окружающей жидкую препаративную форму. Такое уменьшение воздействия кислорода может быть достигнуто путем удаления кислорода из окружающей атмосферы, контактирующей с препаративной формой. Из-за этого содержание кислорода в окружающей атмосфере снижается по сравнению с атмосферным содержанием кислорода приблизительно на 21%, предпочтительно, по меньшей мере, на 30%, предпочтительно, по меньшей мере, на 50%, более предпочтительно, по меньшей мере, на 70%, 80%, 90% или еще более предпочтительно, по меньшей мере, на 95%. Наиболее предпочтительно, чтобы окружающая атмосфера, контактирующая с жидкой препаративной формой практически не содержала кислорода. В этом контексте выражение «практически не содержать кислорода» относится к содержанию кислорода менее 5%, предпочтительно 2% или менее, более предпочтительно 1% или менее, например 0,5% или 0,2%, 0,1% или 0%.

[0081] Как показано в примерах, уменьшение воздействия кислорода на жидкую препаративную форму может заметно снизить деградацию активного ингредиента (например, триазольного фунгицида) при хранении, что приводит к повышению стабильности при хранении и продлению срока хранения соответствующей препаративной формы.

[0082] В предпочтительном варианте осуществления изобретения контейнер содержит мало свободного пространства или не содержит совсем.

[0083] Свободное пространство представляет собой пространство внутри герметичного контейнера, которое не заполнено продуктом, в частности, жидкой

препаративной формой. «Уменьшенное свободное пространство» означает, что объем свободного пространства составляет менее 30% от объема жидкой препаративной формы, предпочтительно менее 20%, более предпочтительно менее 10%, еще более предпочтительно менее 5% от объема жидкой препаративной формы.

[0084] В некоторых случаях можно изготавливать содержащие препаративную форму контейнеры, которые практически не имеют свободного пространства. Это означает, что свободное пространство составляет менее 5%, предпочтительно менее 2%, более предпочтительно менее 1% от объема жидкой препаративной формы, которая содержится в контейнере.

[0085] Малое свободное пространство в контейнере или его отсутствие предпочтительнее в тех случаях, когда нет необходимости в повторном суспендировании жидкой препаративной формы путем встряхивания. С другой стороны, определенное свободное пространство необходимо в тех случаях, когда активный ингредиент может оседать во время хранения и его необходимо повторно суспендировать перед использованием. В таких случаях обычно требуется, по меньшей мере, около 15% свободного пространства (от общего объема контейнера) для обеспечения возможности повторного суспендирования активного ингредиента. Как правило, подходящий диапазон минимального свободного пространства составляет 15 - 18%, но может варьироваться в зависимости от препаративной формы.

[0086] В другом предпочтительном варианте осуществления изобретения контейнер представляет собой воздухонепроницаемую систему, герметично закрытую материалом контейнера, непроницаемым для воздуха. Такая воздухонепроницаемая система может быть использована в комбинации с уменьшенным свободным пространством или отсутствием свободного пространства в контейнере.

[0087] В одном предпочтительном варианте осуществления указанный контейнер уменьшает или предотвращает диффузию кислорода.

[0088] В другом предпочтительном варианте осуществления изобретения воздействие кислорода на этапе (b) уменьшают за счет уменьшения содержания кислорода в свободном пространстве в указанном контейнере.

[0089] Уменьшение содержания кислорода в свободном пространстве контейнера может осуществляться несколькими способами. В одном варианте

осуществления изобретения уменьшение воздействия кислорода на этапе (b) осуществляют путем откачивания воздуха из указанного контейнера. Откачивание воздуха из контейнера может осуществляться до или после заполнения указанного контейнера жидкой препаративной формой. Применимость этого метода зависит от формы и материала контейнера.

[0090] Вакуумная упаковка включает упаковку продукта в контейнеры с низкой кислородопроницаемостью или без нее и герметизацию после откачки воздуха. С использованием этого метода уровень кислорода можно снизить до менее 1%. Барьерные свойства материала контейнера ограничивают проникновение кислорода снаружи контейнера.

[0091] В другом варианте осуществления изобретения уменьшение воздействия кислорода на этапе (b) осуществляют путем откачивания воздуха из указанного контейнера и последующего заполнения контейнера газом. В качестве альтернативы, уменьшение воздействия кислорода на этапе (b) осуществляют промывкой или продувкой контейнера газом (то есть методом продувки газом). Предпочтительно газ представляет собой инертный газ (например, благородный газ), неактивный газ или смеси этих газов. В одном варианте осуществления изобретения такой газ представляет собой инертный газ.

[0092] Газы, пригодные для использования в соответствии с изобретением, представляют собой газы, отрицательно не влияющие на стабильность активного ингредиента (например, триазольного фунгицида). Пригодные газы включают, помимо прочего, водород, азот, гелий, неон, аргон, криптон, ксенон, радон, диоксид углерода, оксид азота, сероводород, низший алкан, галогеналкан, алкоксиалкан или их смеси. В одном аспекте газ представляет собой азот, аргон, диоксид углерода или их смесь.

[0093] В некоторых аспектах газ представляет собой смесь газов, содержащую от около 0,5%, около 10%, от около 0,5% до около 5%, или около 0,5%, или около 2,5% инертного газа (например, благородного газа), такого как неон, аргон, криптон, ксенон или радон. В одном аспекте газ представляет собой смесь газов, содержащую от около 0,5%, около 10%, от около 0,5% до около 5%, или около 0,5%, или около 2,5% аргона.

[0094] В других аспектах газ представляет собой смесь газов, содержащую приблизительно 0,5%, приблизительно 1%, приблизительно 2%, приблизительно 3%, приблизительно 4% или приблизительно 5% инертного газа (например,

благородного газа), такого как неон, аргон, криптон, ксенон или радон. В одном аспекте газ представляет собой смесь газов, содержащую приблизительно 0,5%, приблизительно 1%, приблизительно 2%, приблизительно 3%, приблизительно 4% или приблизительно 5% аргона.

[0095] В некоторых вариантах осуществления настоящего изобретения используют технологию, называемую «компенсация вакуума». При технологии компенсации вакуума осуществляют удаление воздуха внутри контейнера, и в атмосфере внутри упаковки создают вакуум, а затем вакуум заполняют газовой смесью необходимого состава. Поскольку замещение воздуха выполняют в два этапа, производительность ниже, чем при использовании метода продувки газом. Однако, поскольку воздух удаляют путем вакуумирования, а не просто разбавляют, этот процесс более эффективен в отношении уровней остаточного кислорода. Повторное наполнение предпочтительно производить сразу после вакуумирования, чтобы избежать проникновения воздуха в контейнер, из которого был удален воздух.

[0096] В более предпочтительном варианте осуществления вакуумирование указанного контейнера и последующее заполнение газом, предпочтительно инертным газом или смесями газов, предпочтительно инертными газами, повторяют, по меньшей мере, дважды. В зависимости от эффективности этапа, т.е. от остаточного процентного содержания кислорода в контейнере, этот этап может повторяться до тех пор, пока не будет достигнуто необходимое содержание кислорода.

[0097] В другом предпочтительном варианте осуществления изобретения воздействие кислорода на этапе (b) снижается за счет продувки указанного свободного пространства соответствующим газом, предпочтительно инертным газом или смесью таких газов, которая содержит меньше кислорода по сравнению с воздухом, или смесью, не содержащей кислорода. Таким образом, создается измененная атмосфера. Как правило, указанная продувка может производиться до или после заполнения контейнера жидкой препаративной формой. Тем не менее, этап продувки предпочтительно осуществляют после заполнения контейнера жидкой препаративной формой.

[0098] В более предпочтительном варианте осуществления указанный газ представляет собой азот. Продувка азотом представляет собой метод консервации, используемый для защиты упакованных пищевых продуктов и химических средств

защиты растений. Устройства для продувки и герметизации азотом используют для вытеснения воздуха из упаковки и введения в упаковку газообразного азота.

[0099] В предпочтительном варианте осуществления изобретения указанный контейнер уменьшает или предотвращает диффузию кислорода.

[00100] Уменьшение степени диффузии кислорода или предотвращение диффузии кислорода может зависеть от одного или более материалов, используемых для изготовления контейнера. Кроме того, контейнер может состоять из материала, который предотвращает или уменьшает диффузию. В качестве альтернативы контейнер изнутри или снаружи может быть покрыт пленкой, уменьшающей или предотвращающей диффузию кислорода.

[00101] В другом предпочтительном варианте осуществления изобретения уменьшение воздействия кислорода на этапе (b) осуществляют: (i) обеспечением кислородопоглощающего агента внутри контейнера, (ii) введением кислородопоглощающего агента в контейнер и затем запечатыванием указанного контейнера или (iii) включением кислородопоглощающего агента в материал контейнера и/или в закрывающее устройство; и затем запечатыванием указанного контейнера после заполнения его препаративной формой. Кислородопоглощающий материал может быть включен в стенку контейнера и/или в закрывающее устройство, такое как крышка контейнера.

[00102] Предпочтительно, чтобы уменьшение воздействия кислорода на этапе (b) осуществлялось путем (i) подачи кислородопоглощающего агента внутри контейнера или (iii) включения кислородопоглощающего агента в материал контейнера и/или в закрывающее устройство, наиболее предпочтительно, чтобы уменьшение воздействия кислорода на этапе (b) осуществлялось путем (iii) включения кислородопоглощающего агента в материал контейнера и/или в закрывающее устройство.

[00103] Подача кислородопоглощающего агента внутри контейнера или его включение в материал контейнера и/или в закрывающее устройство может осуществляться с использованием так называемой технологии активной упаковки, которую обычно используют для пищевых продуктов или фармацевтических препаратов. Один тип активной упаковки относится к использованию поглотителей кислорода или раскислителей для удаления кислорода из закрытой упаковки. Такие системы могут, например, быть встроены в картон или могут быть встроены в упаковочные пленки или формованные конструкции, например, система,

описанная в патенте США № 5660761, или система, известная как SHELFPLUS[®] O2 (Albis). Другими подходящими материалами являются материалы на основе железа, такие как продукты ATCO[®] или AGELESS[®], упакованные в пакеты. Пакеты ATCO[®] содержат мелкодисперсный железный порошок с низким содержанием серы. Еще одним кислородопоглощающим материалом является RP-K, состоящий из ненасыщенных органических компонентов, диатомовой земли, полиэтилена, Ca(OH)₂ и абсорбирующего графитового соединения.

[00104] В другом предпочтительном варианте осуществления изобретения уменьшение воздействия кислорода на этапе (b) осуществляют: (i) обеспечением кислородопоглощающего агента внутри контейнера, (ii) введением кислородопоглощающего агента в контейнере и затем запечатыванием указанного контейнера или (iii) включением кислородопоглощающего агента в материал контейнера и/или в закрывающее устройство, и в дополнение, путем уменьшения содержания кислорода в контейнере другими способами, такими как вакуумизация указанного контейнера и последующее заполнение газом, предпочтительно инертным газом или смесями газов, предпочтительно инертных газов, или продувка указанного свободного пространства газом, предпочтительно инертным газом, или смесью газов, предпочтительно инертных газов, содержащей меньшее количество кислорода по сравнению с воздухом, или смесью газов, не содержащей кислорода.

[00105] Содержание кислорода в контейнере можно дополнительно снизить путем дегазации жидкой препаративной формы или путем продувки жидкой препаративной формы инертным газом, неактивным газом или их смесью.

[00106] Герметичный контейнер изготовлен из любого воздухонепроницаемого материала. Предпочтительно контейнер изготовлен из пластикового материала, который может быть загерметизирован с использованием стандартного процесса термосварки или такого другого известного специалистам процесса герметизации клеем. Контейнер может быть прозрачным, полупрозрачным или непрозрачным и может быть сформирован из цельного куска материала или из нескольких кусков материала, при этом все края контейнера герметизированы для предотвращения попадания воздуха снаружи. В предпочтительном варианте осуществления изобретения контейнер непрозрачен, чтобы ограничить воздействие света на жидкую препаративную форму. В другом варианте осуществления изобретения контейнер обернут непрозрачным

материалом (например, фольгой) для предотвращения воздействия света на жидкую препаративную форму.

[00107] Контейнер может дополнительно включать клапан одностороннего действия, который позволяет газу выходить изнутри контейнера, не позволяя поступать воздуху снаружи. На контейнер также могут быть нанесены соответствующие идентифицирующие знаки с описанием содержащихся продуктов и другие полезные данные. Знаки могут быть нанесены непосредственно на поверхность контейнера или на прикрепленную этикетку.

[00108] Обработку препаративными формами, описанными в настоящем документе, могут осуществлять любыми методами, известными специалистам. Такие способы могут включать: опрыскивание, окунание, распыление и ряд специальных методов для непосредственной подземной или надземной обработки целых растений или их частей (семян, корней, столонов, стеблей, листьев), например, инъекция в ствол дерева или прививка для многолетних растений, а также ряд специальных не прямых методов обработки.

[00109] В общем, обработку осуществляют обычными, известными специалистам способами в обычных количествах, например, в количестве от нескольких сотен литров воды на гектар при стандартном опрыскивании более нескольких литров масла на гектар при обработке с самолета в сверхмалых объемах до нескольких миллилитров физиологических растворов при инъекционных процедурах. Следовательно, концентрации средств защиты растений по изобретению в соответствующих носителях для обработки варьируются в широком диапазоне и зависят от соответствующей области применения. Как правило, используют известные специалистам концентрации, обычные для соответствующей области применения. Предпочтительными являются концентрации 0,01% - 99 мас.%, особенно предпочтительно 0,1% - 90 мас.%.

[00110] Агрохимические препаративные формы по изобретению могут, например, применяться обычным для жидких препаратов образом, как в отдельности, так и после предварительного разбавления водой, то есть в виде эмульсий, суспензий или растворов. Обработку осуществляют обычными способами, например, путем распыления, заливки или инъекции.

[00111] Препаративные формы по настоящему изобретению при обработке могут быть разбавлены или не разбавлены водой. В целом, они содержат, по меньшей мере, одну часть воды, предпочтительно 10 частей воды, более

предпочтительно, по меньшей мере, 100 частей воды, например 1 - 10 000, предпочтительно 10 - 5000, наиболее предпочтительно 50 - 24 000 частей воды от общего количества разбавленной препаративной формы.

[00112] Таким же образом настоящим изобретением предоставляется эмульсия, которую можно получить путем смешивания воды с жидкой препаративной формой по изобретению. Соотношение смеси воды и концентрата эмульсии может быть в диапазоне от 1000/1 до 1/1, предпочтительно от 400/1 до 10/1.

[00113] Разбавление осуществляют путем выливания концентратов эмульсий по изобретению в воду. Для быстрого смешивания концентрата с водой обычно используют перемешивание. Однако в некоторых случаях смешивание не требуется. Разбавление, как правило, осуществляют при температуре 0 °С - 50 °С, в частности, в диапазоне 10 °С - 30 °С или при температуре окружающей среды.

[00114] Как правило, для разбавления используют водопроводную воду. Однако вода может уже содержать водорастворимые или мелкодисперсные соединения, используемые для защиты растений, такие как питательные вещества, удобрения или пестициды.

[00115] Могут быть добавлены различные типы масел, смачивающих агентов, адъювантов, удобрений или микроэлементов, а также другие пестициды (например, гербициды, инсектициды, фунгициды, регуляторы роста, антидоты). Эти агенты могут добавляться в препаративные формы по изобретению в массовом отношении от 1:100 до 100:1, предпочтительно от 1:10 до 10:1.

[00116] В некоторых аспектах обработка препаративной формой по настоящему изобретению осуществляется пользователем с помощью устройства для предварительной дозировки, ранцевого шприца, бака для опрыскивания, самолета для распыления или ирригационной системы. В некоторых аспектах препаративную форму по изобретению разбавляют водой, буфером и/или другими вспомогательными веществами до концентрации, необходимой для обработки, в результате чего получают готовую к применению жидкость для опрыскивания или агрохимическую композицию по изобретению. Как правило, гектар сельскохозяйственной площади обрабатывают готовой смесью для опрыскивания в количестве 20 - 2000 л, предпочтительно 50 - 400 л.

[00117] Требуемые нормы внесения чистых активных ингредиентов без вспомогательных веществ в составе зависят от интенсивности заражения

вредителями, от фазы развития растений, от условий окружающей среды в месте использования и от способа обработки. В целом, доза внесения находится в диапазоне 0,001 - 3 кг, предпочтительно 0,005 - 2 кг, более предпочтительно 0,01 - 1 кг, наиболее предпочтительно 50 - 500 г активного ингредиента на гектар, при этом активное вещество представляет собой триазольный фунгицид (например, протиоконазол) и/или пиразольный фунгицид (например, пенфлуфен) плюс другие активные ингредиенты, добавляемые при необходимости.

[00118] В некоторых вариантах осуществления изобретения разбавленные препаративные формы по изобретению наносят в основном путем опрыскивания, в частности, путем опрыскивания листьев. Нанесение может осуществляться с использованием известных специалистам методов распыления, например, с использованием воды в качестве носителя, при этом распыляемый объем составляет приблизительно 50 - 1000 л/га, например, 100 - 1000 л/га.

[00119] Описанные препаративные формы, содержащие триазольный фунгицид (например, протиоконазол), обладают преимущественными характеристиками для обработки растений, в частности, они характеризуются предпочтительными свойствами, относящимися к эффективности обработки, высокой стабильностью и высокой фунгицидной активностью.

[00120] В зависимости от свойств дополнительных активных ингредиентов, присутствующих в препаративной форме вместе с активным ингредиентом, триазолом (например, протиоконазол), препаративные формы по изобретению обеспечивают возможность борьбы с более широким спектром вредителей и могут быть использованы для обработки сельскохозяйственных культур, неживых веществ и/или для обработки внутри помещений.

[00121] Препаративной формой по изобретению могут обрабатываться любые растения или любые части растения.

[00122] В контексте настоящего документа термин «растения» означает все растения и популяции растений, такие как желательные и нежелательные дикорастущие растения или сельскохозяйственные культуры (включая свободнорастущие сельскохозяйственные культуры). К сельскохозяйственным культурам, соответственно, могут относиться растения, которые могут быть получены путем обычного разведения растений и способов оптимизации, или способами биотехнологии и геной инженерии, или путем сочетания данных методов, включая генетически модифицированные растения (ГМО или

трансгенные растения) и их сорта, которые могут быть защищены и могут быть незащищены правами растениеводов-селекционеров.

[00123] Генетическими модифицированными растениями (ГМО или трансгенными растениями) являются растения, у которых в геноме устойчиво встроен гетерологичный ген. Выражение «гетерологичный ген», по существу, означает ген, который создан или собран вне растения, и который, при введении в ядерный, хлоропластный или митохондриальный геном, дает трансформированное растение с новыми или улучшенными агротехническими или другими свойствами, за счет экспрессии целевого белка или полипептида, или за счет отрицательной регуляции или сайленсинга другого (других) гена (генов), которые присутствуют в растении (с использованием, например, антисмысловой технологии, косупрессорной технологии или технологии РНК-интерференции (RNAi) или технологии микроРНК (miRNA)). Гетерологичный ген, который локализован в геноме, также называется трансгеном. Трансген, который определен конкретной локализацией в геноме растения, называют трансформационным или трансгенным объектом.

[00124] В контексте настоящего документа под термином «сорта растений» подразумевают растения, обладающие новыми свойствами («характеристиками»), которые были получены методами обычного разведения, мутагенезом или с применением технологии рекомбинантных ДНК. Это могут быть сорта, разновидности, био- или генотипы.

[00125] Под частями растения понимают все части и органы растения, которые располагаются над и под землей, такие как побеги, листья, иглы, цветоножки, стебли, цветки, плодовые тела, плоды, семена, корни, клубни и корневища. К частям растений также относится собранный материал и материал для вегетативного и генеративного размножения, например, черенки, клубни, корневища, побеги и семена.

[00126] Растения, которые могут подвергаться обработке способами по изобретению, включают: хлопок, лен, виноград, фрукты, овощи, такие как *Rosaceae* sp. (например, семечковые, такие как яблоки и груши, а также косточковые, такие как абрикосы, вишня, миндаль и персики, и ягоды, такие как клубника), *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (например, банановые деревья и плантации), *Rubiaceae* sp. (например, кофе), *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp.,

Rutaceae sp. (например, лимоны, апельсины и грейпфрут); *Solanaceae* sp. (например, помидоры), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (например, латук), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp. (например, огурец), *Alliaceae* sp. (например, лук-порей, лук), *Papilionaceae* sp. (например, горох); основные сельскохозяйственные культуры, такие как *Gramineae* sp. (например, кукуруза, дерновые культуры, злаки, такие как пшеница, рожь, рис, ячмень, овес, просо и тритикале), *Asteraceae* sp. (например, подсолнечник), *Brassicaceae* sp. (например, белокочанная капуста, краснокочанная капуста, брокколи, цветная капуста, брюссельская капуста, пак-чой, кольраби, редис и масличный рапс, горчица, хрен и кресс-салат), *Fabaceae* sp. (например, бобы, горох), *Papilionaceae* sp. (например, соя), *Solanaceae* sp. (например, картофель), *Chenopodiaceae* sp. (например, сахарная свекла, кормовая свекла, мангольд, столовая свёкла); полезные растения и декоративные растения для садов и лесопосадок; а также генетически модифицированные разновидности данных растений.

[00127] Растения и сорта растений, которые могут подвергаться обработке описанными способами, включают растения, которые являются устойчивыми к одному или нескольким факторам биотического стресса, т.е. указанные растения проявляют повышенную устойчивость по отношению к животным-вредителям и микробиальным вредителям, например, к нематодам, насекомым, клещам, фитопатогенным грибам, бактериям, вирусам и/или вириоидам.

[00128] Растения и сорта растений, которые могут быть обработаны описанными способами, включают такие растения, которые являются устойчивыми к одному или нескольким факторам абиотического стресса. Условия абиотического стресса включают, например, засуху, высокие и низкие температуры, осмотический стресс, затопление, повышенная засоленность почвы, повышенное присутствие минералов в почве, присутствие экстраординарных количеств озона, избыточный свет, недостаток азотных или фосфорных питательных веществ, отсутствие затенения.

[00129] Растения и сорта растений, которые могут быть обработаны описанными способами, включают такие растения, которые характеризуются характеристиками улучшенной урожайности. Улучшенная урожайность указанных растений может быть результатом, например, улучшенных показателей физиологии, роста и развития растения, таких как эффективность использования воды, эффективность влагоудерживания, улучшенная усвояемость азота,

усиленная ассимиляция углерода, улучшенный фотосинтез, повышенная всхожесть и ускоренное созревание. На урожайность, кроме того, может оказывать влияние улучшение организации растений (при стрессовых и нестрессовых условиях), включая, помимо прочего, раннее начало цветения, контроль цветения для получения гибридных семян, всхожесть, размер растения, количество междоузлий и расстояние между ними, рост корневой системы, размер семян, размер плодов, размер стручков, количество стручков или колосьев, количество семян в стручке или колосе, масса семени, увеличение процентного отношения выполненных семян, сниженное осыпание семян, сниженное растрескивание стручков и устойчивость к полеганию. Другие характеристики урожайности включают состав семян, например, содержание и композиция углеводов, например, хлопок или крахмал, содержание белков, масличность и состав жиров, пищевую ценность, сниженное содержание не обладающих пищевой ценностью веществ, улучшенную пригодность для переработки и лучшую устойчивость при хранении.

[00130] Растения и сорта растений, которые могут быть обработаны описанными способами, включают гибридные растения, которые уже проявляют признаки гетерозиса или гибридной силы, что в результате приводит в целом к улучшенной урожайности, силе, жизнеспособности и устойчивости к факторам биотического и абиотического стресса.

[00131] Растения и сорта растений (полученные методами биотехнологии растений, такими как геновая инженерия), которые могут быть обработаны описанными способами, включают растения и сорта растений, устойчивые к гербицидам, т.е. растения, обладающие устойчивостью к одному или более определенным гербицидам. Такие растения, которые могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, содержат мутацию, придающую такую устойчивость к гербицидам.

[00132] Растения и сорта растений (полученные методами биотехнологии растений, такими как геновая инженерия), которые могут быть обработаны описанными способами, включают растения и сорта растений, которые являются трансгенными растениями, устойчивыми к насекомым, т.е. растения, которым была придана устойчивость к нападению некоторых целевых насекомых. Такие растения, которые могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, содержат мутацию, придающую такую устойчивость к насекомым.

[00133] Растения и сорта растений (полученные методами биотехнологии растений, такими как генная инженерия), которые могут быть обработаны описанными способами, включают растения и сорта растений, которые являются трансгенными растениями, устойчивыми к заболеваниям, т.е. растения, которым была придана устойчивость к нападению некоторых целевых насекомых. Такие растения, которые могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, содержат мутацию, придающую такую устойчивость к насекомым.

[00134] Растения и сорта растений (полученные методами биотехнологии растений, такими как генная инженерия), которые могут быть обработаны описанными способами, включают растения и сорта растений, устойчивые к факторам абиотического стресса. Такие растения, которые могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, содержат мутацию, придающую такую устойчивость к стрессу.

[00135] Растения и сорта растений (полученные методами биотехнологии растений, такими как генная инженерия), которые могут быть обработаны описанными способами, включают растения и сорта растений, которые демонстрируют измененные количественные и качественные характеристики и/или характеристики устойчивости при хранении собранного продукта урожая и/или измененные характеристики определенных ингредиентов собранного продукта урожая.

[00136] Растения и сорта растений (полученные методами биотехнологии растений, такими как генная инженерия), которые могут быть обработаны описанными способами, включают растения и сорта растений, такие как растения хлопчатника, с измененными характеристиками волокна. Такие растения, которые могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, содержат мутацию, придающую такие измененные свойства волокну.

[00137] Растения и сорта растений (полученные методами биотехнологии растений, такими как генная инженерия), которые могут быть обработаны описанными способами, включают растения и сорта растений, такие как масличный рапс и родственные растения Brassica, с измененными характеристиками профиля масла. Такие растения, которые могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, содержат мутацию, придающую такие измененные профильные свойства маслу.

[00138] Растения и сорта растений (полученные методами биотехнологии растений, такими как генная инженерия), которые могут быть обработаны описанными способами, включают растения и сорта растений, такие как масличный рапс и родственные растения *Brassica*, с измененными характеристиками осыпания семян. Такие растения, которые могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, содержат мутацию, придающую такие измененные характеристики осыпания семян, и включают растения, такие как масличный рапс с запоздалым или пониженным осыпанием семян.

[00139] Растения и сорта растений (полученные методами биотехнологии растений, такими как генная инженерия), которые могут быть обработаны описанными способами, включают растения и сорта растений, такие как табак, с измененными профилями посттрансляционной модификации белка.

[00140] Примеры патогенов грибковых заболеваний, которые могут подвергаться обработке согласно изобретению, помимо прочего, включают:

[00141] заболевания, вызванные патогенами мучнистой росы, например, видами *Blumeria*, например, *Blumeria graminis*; видами *Podosphaera*, например, *Podosphaera leucotricha*; видами *Sphaerotheca*, например, *Sphaerotheca fuliginea*; видами *Uncinula*, например, *Uncinula necator*;

[00142] заболевания, вызванные возбудителями ржавчинных заболеваний, например, видами *Gymnosporangium*, например, *Gymnosporangium sabinae*; видами *Hemileia*, например, *Hemileia vastatrix*; видами *Phakopsora*, например, *Phakopsora pachyrhizi* или *Phakopsora meibomiae*; видами *Puccinia*, например, *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis* или *Puccinia striiformis*; видами *Uromyces*, например, *Uromyces appendiculatus*;

[00143] заболевания, вызванные патогенами из группы оомицетов, например, видами *Albugo*, например, *Albugo candida*; видами *Bremia*, например, *Bremia lactucae*; видами *Peronospora*, например, *Peronospora pisi* или *P. brassicae*; видами *Phytophthora*, например, *Phytophthora infestans*; видами *Plasmopara*, например, *Plasmopara viticola*; видами *Pseudoperonospora*, например, *Pseudoperonospora humuli* или *Pseudoperonospora cubensis*; видами *Pythium*, например, *Pythium ultimum*;

[00144] заболевания пятнистости листьев и заболевания увядания листьев, вызванные, например, видами *Alternaria*, например, *Alternaria solani*; видами

Cercospora, например, *Cercospora beticola*; видами *Cladosporium*, например, *Cladosporium cucumerinum*; видами *Cochliobolus*, например, *Cochliobolus sativus* (конициальная форма: *Drechslera*, син: *Helminthosporium*) или *Cochliobolus miyabeanus*; видами *Colletotrichum*, например, *Colletotrichum lindemuthanium*; видами *Corynespora*, например, *Corynespora cassicola*; видами *Cycloconium*, например, *Cycloconium oleaginum*; видами *Diaporthe*, например, *Diaporthe citri*; видами *Elsinoe*, например, *Elsinoe fawcettii*; видами *Gloeosporium*, например, *Gloeosporium laeticolor*; видами *Glomerella*, например, *Glomerella cingulata*; видами *Guignardia*, например, *Guignardia bidwellii*; видами *Leptosphaeria*, например, *Leptosphaeria maculans*; видами *Magnaporthe*, например, *Magnaporthe grisea*; видами *Microdochium*, например, *Microdochium nivale*; видами *Mycosphaerella*, например, *Mycosphaerella graminicola*, *Mycosphaerella arachidicola* или *Mycosphaerella fijiensis*; видами *Phaeosphaeria*, например, *Phaeosphaeria nodorum*; видами *Pyrenophora*, например, *Pyrenophora teres* или *Pyrenophora tritici repentis*; видами *Ramularia*, например, *Ramularia collo-cygni* или *Ramularia areola*; видами *Rhynchosporium*, например, *Rhynchosporium secalis*; видами *Septoria*, например, *Septoria apii* или *Septoria lycopersici*; видами *Stagonospora*, например, *Stagonospora nodorum*; видами *Typhula*, например, *Typhula incarnata*; видами *Venturia*, например, *Venturia inaequalis*;

[00145] заболевания корня и стебля, вызванные, например, видами *Corticium*, например, *Corticium graminearum*; видами *Fusarium*, например, *Fusarium oxysporum*; видами *Gaeumannomyces*, например, *Gaeumannomyces graminis*; видами *Plasmodiophora*, например, *Plasmodiophora brassicae*; видами *Rhizoctonia*, например, *Rhizoctonia solani*; видами *Sarocladium*, например, *Sarocladium oryzae*; видами *Sclerotium*, например, *Sclerotium oryzae*; видами *Tapesia*, например, *Tapesia aciformis*; видами *Thielaviopsis*, например, *Thielaviopsis basicola*;

[00146] заболевания колоса и метелки (включая кукурузные початки), вызванные, например, видами *Alternaria*, например, *Alternaria* spp.; видами *Aspergillus*, например, *Aspergillus flavus*; видами *Cladosporium*, например, *Cladosporium cladosporioides*; видами *Claviceps*, например, *Claviceps purpurea*; видами *Fusarium*, например, *Fusarium culmorum*; видами *Gibberella*, например, *Gibberella zeae*; видами *Monographella*, например, *Monographella nivalis*; видами *Stagnospora*, например, *Stagnospora nodorum*;

[00147] заболевания, вызванные головневыми грибами, например, видами *Sphacelotheca*, например, *Sphacelotheca reiliana*; видами *Tilletia*, например, *Tilletia caries* или *Tilletia controversa*; видами *Urocystis*, например, *Urocystis occulta*; видами *Ustilago*, например, *Ustilago nuda*;

[00148] плодовая гниль, вызванная, например, видами *Aspergillus*, например, *Aspergillus flavus*; видами *Botrytis*, например, *Botrytis cinerea*; видами *Monilinia*, например, *Monilinia laxa*; видами *Penicillium*, например, *Penicillium expansum* или *Penicillium purpurogenum*; видами *Rhizopus*, например, *Rhizopus stolonifer*; видами *Sclerotinia*, например, *Sclerotinia sclerotiorum*; видами *Verticillium*, например, *Verticillium alboatrum*;

[00149] заболевания гнили и увядания саженцев, передающиеся через семена и почву, вызванные, например, видами *Alternaria*, например, *Alternaria brassicicola*; видами *Aphanomyces*, например, *Aphanomyces euteiches*; видами *Ascochyta*, например, *Ascochyta lentis*; видами *Aspergillus*, например, *Aspergillus flavus*; видами *Cladosporium*, например, *Cladosporium herbarum*; видами *Cochliobolus*, например, *Cochliobolus sativus* (конидиальная форма: *Drechslera*, Биполярис Син: *Helminthosporium*); видами *Colletotrichum*, например, *Colletotrichum coccodes*; видами *Fusarium*, например, *Fusarium culmorum*; видами *Gibberella*, например, *Gibberella zeae*; видами *Macrophomina*, например, *Macrophomina phaseolina*; видами *Microdochium*, например, *Microdochium nivale*; видами *Monographella*, например, *Monographella nivalis*; видами *Penicillium*, например, *Penicillium expansum*; видами *Phoma*, например, *Phoma lingam*; видами *Phomopsis*, например, *Phomopsis sojae*; видами *Phytophthora*, например, *Phytophthora cactorum*; видами *Pyrenophora*, например, *Pyrenophora graminea*; видами *Pyricularia*, например, *Pyricularia oryzae*; видами *Pythium*, например, *Pythium ultimum*; видами *Rhizoctonia*, например, *Rhizoctonia solani*; видами *Rhizopus*, например, *Rhizopus oryzae*; видами *Sclerotium*, например, *Sclerotium rolfsii*; видами *Septoria*, например, *Septoria nodorum*; видами *Typhula*, например, *Typhula incarnata*; видами *Verticillium*, например, *Verticillium dahliae*;

[00150] раковые заболевания, заболевания, вызванные галловыми нематодами, и ведьмина метла, вызванные, например, видами *Nectria*, например, *Nectria galligena*;

[00151] фузариозное увядание, вызванное, например, видами *Verticillium*, например, *Verticillium longisporum*; видами *Fusarium*, например, *Fusarium oxysporum*;

[00152] деформации листьев, цветов и плодов, вызванные, например, видами *Exobasidium*, например, *Exobasidium vexans*; видами *Taphrina*, например, *Taphrina deformans*;

[00153] дегенеративные заболевания древесных растений, вызванные, например, видами *Esca*, например, *Phaeoconiella chlamydospora*, *Phaeoacremonium aleophilum* или *Fomitiporia mediterranea*; видами *Ganoderma*, например, *Ganoderma boninense*;

[00154] болезни клубней растения, вызываемые, например, видами *Rhizoctonia*, например, *Rhizoctonia solani*; видами *Helminthosporium*, например, *Helminthosporium solani*;

[00155] заболевания, вызываемые бактериальными патогенами, например, видами *Xanthomonas*, например, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*; видами *Pseudomonas*, например, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*; видами *Erwinia*, например, *Erwinia amylovora*; видами *Liberibacter*, например, *Liberibacter asiaticus*; видами *Xylella*, например, *Xylella fastidiosa*; видами *Ralstonia*, например, *Ralstonia solanacearum*; видами *Dickeya*, например, *Dickeya solani*; видами *Clavibacter*, например, *Clavibacter michiganensis*; видами *Streptomyces*, например, *Streptomyces scabies*.

[00156] заболевания сои:

[00157] Грибковые заболевания листьев, стеблей, стручков и семян, например, пятнистость листьев *Alternaria* (*Alternaria spec. atrans tenuissima*), антракноз (*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*), ржавая пятнистость (*Septoria glycines*), церкоспороз (*Cercospora kikuchii*), пятнистость листьев, вызываемая грибами хоанефора (*Choanephora infundibulifera trispora* (Syn.)), пятнистость листьев, вызываемая грибами дактулиофора (*Dactuliophora glycines*), ложная мучнистая роса (*Peronospora manshurica*), увядание, вызываемое грибами рода дрекслера (*Drechslera glycini*), церкоспороз сои (*Cercospora sojae*), пятнистость листьев, вызываемая грибами лептосферулина (*Leptosphaerulina trifolii*), пятнистость листьев, вызываемая грибами филлостика (*Phyllosticta sojaecola*), ожог бобов и стеблей сои (*Phomopsis sojae*), настоящая мучнистая роса (*Microsphaera diffusa*), пятнистость листьев, вызываемая грибами рода пиренохета

(*Pyrenochaeta glycines*), ризоктониоз (*Rhizoctonia solani*), ржавчина (*Phakopsora pachyrhizi*, *Phakopsora meibomia*), парша (*Sphaceloma glycines*), увядание листьев, вызываемое грибами рода стемфилиум (*Stemphylium botryosum*), синдром внезапной смерти (*Fusarium virguliforme*), коринеспорозная пятнистость мишеневидная пятнистость листьев (*Corynespora cassiicola*).

[00158] Грибковые заболевания корней и оснований стебля, например, черная корневая гниль (*Calonectria crotalariae*), угольная гниль (*Macrophomina phaseolina*), фузариоз или фузариозный вилт, корневая гниль и гниль стручка и корневой шейки (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium orthoceras*, *Fusarium semitectum*, *Fusarium equiseti*), гниение корней, вызываемое видами миколептодискус (*Mycoleptodiscus terrestris*), неосмоспора (*Neocosmospora vasinfecta*), гниль бобов и стеблей (*Diaporthe phaseolorum*), стеблевой рак (*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*), фитофтороз (*Phytophthora megasperma*), бурая гниль стеблей сои (*Phialophora gregata*), грибная гниль (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium irregulare*, *Pythium debaryanum*, *Pythium myriotylum*, *Pythium ultimum*), ризоктониоз, войлочная болезнь и выпревание (*Rhizoctonia solani*), склеротиниоз (*Sclerotinia sclerotiorum*), склероциальная южная гниль (*Sclerotinia rolfsii*), гниение корней, вызываемое видами тиелавиопсис (*Thielaviopsis basicola*).

[00159] Препаративные формы по изобретению могут также быть использованы для защиты материалов, в частности, для защиты промышленных материалов от воздействия фитопатогенных грибов и разрушения фитопатогенными грибами.

[00160] В дополнение, препаративные формы по изобретению могут быть использованы в качестве композиций, предохраняющих от биологического обрастания, в отдельности или в комбинации с другими активными ингредиентами.

[00161] В контексте настоящего изобретения под термином «промышленные материалы» подразумевают неживые материалы, которые предназначены для применения в промышленности. Например, промышленными материалами, защита которых от изменений или разрушения вследствие воздействия микроорганизмов может осуществляться по изобретению, могут являться клеящие вещества, клеи, бумага, обои и доски/картон, текстильные материалы, ковры, кожа, древесина, волокнистая масса и ткани, краска и изделия из пластика, смазывающе-охлаждающие жидкости, и другие материалы, которые могут поражаться или разрушаться микроорганизмами. Также в составе

материалов, защита которых может осуществляться по изобретению, можно упомянуть части производственных установок и зданий, например, контуры циркуляции охлаждающей воды, системы охлаждения и нагрева, а также блоки вентиляции и кондиционирования воздуха, которые могут разрушаться вследствие развития микроорганизмов. Промышленные материалы по настоящему изобретению предпочтительно включают клеящие вещества, клеи, бумагу и картон, кожу, древесину, краску, смазывающе-охлаждающие жидкости и теплообменные жидкости, более предпочтительно, древесину.

[00162] Препаративные формы по изобретению могут предотвращать негативные воздействия, такие как гниение, порча, изменение цвета, обесцвечивание или образование плесени.

[00163] В случае обработки дерева препаративные формы по изобретению могут также быть использованы против грибковых заболеваний, которые могут развиваться на поверхности или внутри лесоматериалов.

[00164] Термин «лесоматериалы» означает все виды пород дерева и все виды обработанной древесины, предназначенные для строительства, например, цельная древесина, древесина высокой плотности, ламинированная древесина и фанера. В дополнение, препаративные формы по изобретению могут быть использованы для защиты от биологического обрастания объектов, которые контактируют с минерализованной или соленой водой, в частности, корпуса судов, экраны, сети, строения, мест стоянки и сигнальных систем.

[00165] Препаративные формы по изобретению могут также быть использованы для защиты продукции при хранении. Термин «складированная продукция» означает природные вещества растительного или животного происхождения и полученные путем их переработки продукты, природного происхождения, для которых необходима долгосрочная защита. Товары для хранения растительного происхождения включают, например, растения или их части, такие как стебли, листья, клубни, семена, плоды или зерно, могут быть защищены в свежесобранном состоянии или в переработанном виде, например, путем предварительного высушивания, увлажнения, измельчения, перемалывания, спрессовывания или высокотемпературной обработки. Товары для хранения также включают лесоматериалы, как сырые лесоматериалы, такие как строительные лесоматериалы, опоры линии электропередачи и ограждения, так и лесоматериалы в виде готовых изделий, такие как мебель. Складированной продукцией животного

происхождения является, например, шкуры, кожа, меховые изделия и изделия из волосяной ткани меха. Препаративные формы по изобретению могут предотвращать негативные воздействия, такие как гниение, порча, изменение цвета, обесцвечивание или образование плесени.

[00166] Препаративные формы по изобретению также могут быть использованы для защиты семян от нежелательных микроорганизмов, таких как фитопатогенные микроорганизмы, например, фитопатогенные грибы или фитопатогенные оомицеты. При использовании по тексту настоящего документа термин «семена» включает семена в состоянии покоя, подготовленные семена, предварительно проросшие семена и семена с появившимися корнями и листьями.

[00167] Таким образом, настоящее изобретение также относится к способу защиты семян от нежелательных микроорганизмов, который включает этап обработки семян препаративной формой по изобретению.

[00168] Обработка семян препаративными формами по изобретению защищает семена от фитопатогенных микроорганизмов, а также защищает прорастающие семена, рассаду и растения после того, как они проросли из обработанных семян. Таким образом, настоящее изобретение также относится к способу защиты семян, прорастающих семян и рассады.

[00169] Обработка семян может осуществляться до посева, во время посева и сразу после него.

[00170] Когда обработку семян осуществляют до посева (например, в виде так называемого нанесения на семена), она может выполняться следующим образом: семена могут быть помещены в смешивающее устройство вместе с необходимым количеством препаративной формы по изобретению, семена и препаративную форму по изобретению смешивают до однородного распределения соединения или композиции на семенах. При необходимости, семена могут затем быть высушены.

[00171] Изобретение также относится к семенам, обработанным препаративными формами по изобретению.

[00172] Предпочтительно, чтобы семена были достаточно твердыми, чтобы не допустить повреждений во время обработки. Обычно обработку семян осуществляют в любое время между сбором урожая и посевом и сразу после посева. Обычно используют семена, которые были отделены от растения и у которых были удалены стержни початка, шелуха, плодоножки, оболочки, волоски или мякоть

плода. Например, могут быть использованы семена, которые были собраны, очищены и высушены так, чтобы содержание влаги составляло менее 15 мас.%. В качестве альтернативы, также могут быть использованы семена, которые после высушивания, например, были обработаны водой, а затем снова высушены, или же семена сразу после их примирования, семена, которые хранятся в примированном состоянии, или предварительно проросшие семена, или же семена, высеянные на брудерных лотках, пленке или бумаге.

[00173] Количество препаративной формы по изобретению, наносимое на семена, как правило, таково, чтобы не навредить процессу прорастания семян и самому растению. Это следует обеспечить, в особенности, в случае использования активных ингредиентов по изобретению, которые могут иметь фитотоксичное воздействие при определенных дозировках. Чтобы обеспечить оптимальную защиту семян и прорастающих растений с минимальным расходом используемого соединения, необходимо также принимать во внимание естественные фенотипы трансгенных растений при определении количества препаративной формы по изобретению, которым обрабатывают семена.

[00174] Препаративные формы по изобретению могут наноситься непосредственно на семена сами по себе, т.е. без использования каких-либо других компонентов, без разбавления.

[00175] Препаративные формы по изобретению могут быть использованы для защиты семян любых сортов растений. Предпочтительно обрабатывают семена злаковых культур (таких как пшеница, ячмень, рожь, просо, тритикале и овес), масличного рапса, кукурузы, хлопка, сои, риса, картофеля, подсолнечника, бобов, кофе, гороха, свеклы (например, сахарной свеклы и кормовой свеклы), арахиса, овощей (таких как помидор, огурец, лук и салат-латук), дерновых и декоративных культур. Более предпочтительно обрабатывают семена пшеницы, сои, масличного рапса, кукурузы и риса.

[00176] Препаративные формы по изобретению могут быть использованы для обработки трансгенных семян, в частности, семян растений, способных экспрессировать полипептид или белок, который действует против вредителей, гербицидного повреждения или абиотического стресса, в результате чего защитный эффект усиливается. Семена растений, способных экспрессировать полипептид или белок, который действует против вредителей, гербицидного повреждения или абиотического стресса, могут содержать, по меньшей мере, один

гетерологичный ген, который обеспечивает экспрессию указанного полипептида или белка. В трансгенных семенах такие гетерологичные гены могут происходить, например, из микроорганизмов, таких родов как *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* или *Gliocladium*. Такие гетерологичные гены предпочтительно происходят из рода *Bacillus*, в этом случае генный продукт обладает эффективностью в отношении огневки кукурузной и/или западной кукурузный жук. Особенно предпочтительны гетерологичные гены, происходящие из *Bacillus thuringiensis*.

[00177] Примеры ниже приводятся исключительно в качестве иллюстрации и не ограничивают объем настоящего изобретения.

ПРИМЕРЫ

Пример 1. Стабилизация протиоконазола в течение двух недель после продувки азотом

[00178] RAXIL[®] PRO MD – это коммерческий продукт, содержащий 1,47% протиоконазола, 0,29% тебуконазола и 0,59% металаксила в водном препарате. Образцы of RAXIL[®] PRO MD подвергали продувке азотом путем барботирования в течение приблизительно 5 мин. Контрольные образцы не подвергали продувке азотом. Затем образцы были разделены на группы, указанные в **Таблице 1**. Часть образцов хранили в темноте, другую часть подвергали воздействию естественного освещения. Кроме того, некоторые образцы были завернуты в фольгу, чтобы свести к минимуму контакт с окружающим кислородом, а другие – нет. Все образцы хранили при комнатной температуре.

[00179] Через две недели хранения при таких условиях в каждом образце определяли количество протиоконазола-дестио путем жидкостной хроматографии и масс-спектрометрии (ЖХ-МС) с использованием SCIEX TRIPLE QUAD[™] 6500 и осуществляли построение стандартной кривой с использованием аналитических стандартов для протиоконазола-дестио. Продувка азотом значительно ингибировала деградацию протиоконазола до протиоконазола-дестио после воздействия света в течение двух недель (сравните образец С с образцом D в **Таблице 1**). Напротив, протиоконазол в образцах, которые не подвергали продувке азотом, деградировал до протиоконазола-дестио на уровнях более чем в десять раз выше, чем уровни, наблюдаемые для образцов, стабилизированных азотом, и

образцов, хранившихся в темноте (сравните образец D с образцами A, B, и C в **Таблице 1**).

Таблица 1

Препарат	Образец	Воздействие света (Да/Нет)	Фольга (Да/Нет)	N ₂ Продувка (Да/Нет)	Противоконазол-дестин мас. %	Противоконазол-дестин мас. (ppm)
RAXIL [®] PRO MD	A	Нет	Да	Да	0.000528%	5.28
	B	Нет	Да	Нет	0.000544%	5.44
	C	Да	Нет	Да	0.000585%	5.85
	D	Да	Нет	Нет	0.007784%	77.84

Пример 2. Стабилизация противоконазола в течение двух месяцев после продувки азотом

[00180] Концентрат суспензии, содержащий 1,45% противоконазола («противоконазол SC»), для стабилизации подвергали продувке азотом, после чего проводили оценку в соответствии с описанием в Примере 1. Все образцы в течение двух месяцев хранили в стеклянных контейнерах, подвергали воздействию естественного освещения при комнатной температуре. Некоторые образцы также были обернуты фольгой, чтобы ограничить воздействие окружающего кислорода. После завершения периода хранения в каждом образце определяли количество противоконазола-дестин путем жидкостной хроматографии и масс-спектрометрии (ЖХ-МС)

[00181] Как наблюдалось для образцов, хранившихся в течение двух недель, в образце, который подвергали воздействию света и окружающего кислорода в течение двух месяцев, произошла деградация противоконазола до противоконазола-дестин на уровнях приблизительно в десять раз превышающих уровни, наблюдаемые у образцов, стабилизированных азотом (сравните образцы A и B с образцом D в **Таблице 2**). Кроме того, ограничение количества окружающего кислорода, поступающего в контейнер для образца, путем обертывания фольгой, значительно ингибировало деградацию противоконазола до противоконазола-дестин (сравните образец C с образцом D в **Таблице 2**). Это исследование проводили с аналогичной группой образцов, которые хранили в течение двух месяцев в пластиковых контейнерах вместо стекла, и были получены аналогичные результаты.

Таблица 2

Препарат	Образец	Фольга (Да/Нет)	N ₂ Продувка (Да/Нет)	Дестио ppm
Противоконазол SC	A	Да	Да	10.46
	B	Нет	Да	16.28
	C	Да	Нет	13.71
	D	Нет	Нет	124.70

Пример 3. Стабилизация противоконазола циклодекстринами

[00182] Были получены водные растворы противоконазола (PTZ) в концентрации приблизительно 1% - 1,5% (мас./мас.). Эти образцы хранили в течение двух недель при 54 °С, в течение восьми недель при 40 °С или в течение 52 недель при 20 °С. В каждом образце измеряли начальное количество PTZ и окончательное количество PTZ после хранения путем ЖХ-МС в соответствии с описанием в Примере 1. На основе этих измерений был рассчитан остаточный процент PTZ после хранения. Эти значения находились в диапазоне приблизительно от 94% до 97% (см. **Фиг. 1А**).

[00183] В ходе отдельного опыта производили оценку способности двух различных циклодекстринов, 2-гидроксипропил-β циклодекстрина (HPCD) и метил-β циклодекстрина (MeCD), стабилизировать PTZ. Водные растворы противоконазола (PTZ) в концентрации приблизительно 1% - 1,5% (мас./мас.) смешивали с 15% (мас./мас.) HPCD или 15% (мас./мас.) MeCD. Контрольный образец не содержит циклодекстринов. Образцы хранили в течение двух недель при 54 °С, затем, как и прежде, производили расчет остаточного процента PTZ после хранения путем ЖХ-МС. Для образцов, содержащих HPCD или MeCD, заметная деградация не наблюдалась, тогда как для контрольного образца степень деградации составила приблизительно 4% - 5% (см. **Фиг. 1В**).

Пример 4. Дифференциальный сканирующий калориметрический анализ физических смесей и комплексов включений, содержащих циклодекстрин

[00184] Были получены физические смеси и комплексы включения, содержащие PTZ и циклодекстрин, затем производили их анализ путем дифференциальной сканирующей калориметрии (ДСК). Физические смеси были

получены путем объединения 1,5 г PTZ и 15 г HPCD. Комплексы включения получали способом выпаривания растворителя: 1,5 г PTZ и 15 г HPCD растворяли в этаноле, а затем растворитель выпаривали в вакууме. Полученный порошок использовали для анализа путем дифференциальной сканирующей калориметрии.

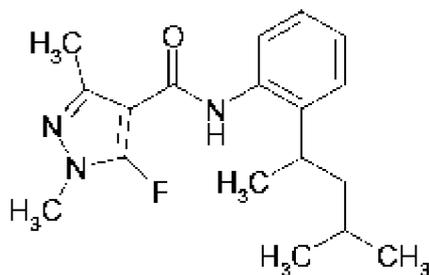
[00185] На **Фиг. 2** показаны профили дифференциальной сканирующей калориметрии (ДСК) (1) PTZ; (2) HPCD; (3) физической смеси протиоконазола и HPCD; и (4) комплекса включения протиоконазола и HPCD. Профиль ДСК (1) PTZ показывает лишь высокодискретный и ярко выраженный пик, который представляет температуру плавления PTZ. Профиль ДСК (2) HPCD показывает лишь практически прямую линию, означающую отсутствие термических явлений, когда HPCD подвергается нагреву. Физическая смесь (3) PTZ и HPCD показывает присутствие температуры плавления, что позволяет предположить, что между PTZ и HPCD не образовался комплекс. Наконец, профиль ДСК (4) PTZ и HPCD, полученных путем испарения растворителя, показывает новый пик, который представляет образование комплекса включения и полное отсутствие точки плавления PTZ. Это указывает на то, что между PTZ и HPCD успешно образовался комплекс включения.

Пример 5. Стабилизация смесей протиоконазола и пенфлуфена с увеличивающимися количествами циклодекстрина

[00186] Образцы RAXIL[®] PRO MD + PFL (1,38% мас./мас.), содержащие метилциклодекстрин (MeCD) в диапазоне 0% (мас./мас.) - 25% (мас./мас.), хранили в течение двух недель при 54°C, затем осуществляли определение средней степени деградации PTZ и PFL путем ВЭЖХ. Образец, содержащий PTZ без PFL или циклодекстрина, на **Фиг. 3 и 4** указан в качестве контрольного образца.

[00187] Деградация PTZ снижалась при добавлении циклодекстрина дозозависимым образом, при этом самая высокая концентрация циклодекстрина приводила к снижению деградации на 86% (см. **Фиг. 3**). Аналогичным образом, добавление циклодекстрина в концентрациях 40% (мас./мас.) и 50% (мас./мас.) предотвращало деградацию PFL с наивысшей концентрацией циклодекстрина, что приводило к снижению разложения на 65% (см. **Фиг. 4**).

[00188] Пенфлуфен представляет собой фунгицид на основе замещенного пиразолкарбоксамиды со следующей структурой:



Пример 6. Стабилизация протиоконазола и пенфлуфена с использованием циклодекстрина при различных температурах в зависимости от времени

[00189] Были получены водные растворы смеси протиоконазола (PTZ) в концентрации приблизительно 1.5% (мас./мас.), и пенфлуфена в концентрации приблизительно 1,65% (мас./мас.), затем осуществляли их смешивание с MeCD, 25 мас.%. Эти образцы хранили в течение двух недель при 54 °С, в течение восьми недель при 40°С или в течение 6 месяцев при 30°С. Затем, в каждом образце измеряли начальное количество PTZ или PFL и окончательное количество PTZ или PFL после хранения путем ЖХ-МС. На основе этих измерений был рассчитан остаточный процент PTZ после хранения (который составил приблизительно 95% - 98%) и остаточный процент PFL после хранения (который составил приблизительно 91,5% - 97,5%). См. **Таблицу 3** и **Таблицу 4**.

Таблица 3

Протиоконазол с 25 мас.% MeCD		
Время	% PTZ	% деградации
T0	1.49	0
54°С в течение 2 недель	1.45	2.68
40°С в течение 8 недель	1.43	4.03
30°С в течение 6 месяцев	1.46	2.01
Пенфлуфен с 25 мас.% MeCD		
Время	% PFL	% деградации
T0	1.68	0
54°С в течение 2 недель	1.6	4.76
40°С в течение 8 недель	1.54	8.33
30°С в течение 6 месяцев	1.62	3.57

Таблица 4

Противоконазол с 25 мас.% MeCD		
Время	% PTZ	% деградации
T0	1.49	0
54°C в течение 2 недель	1.46	2.01
40°C в течение 8 недель	1.42	4.70
30°C в течение 6 месяцев	1.46	2.01
Пенфлуфен с 25 мас.% MeCD		
Время	% PFL	% деградации
T0	1.64	0
54°C в течение 2 недель	1.58	3.66
40°C в течение 8 недель	1.60	2.44
30°C в течение 6 месяцев	1.58	3.66

[00190] Если не оговорено иное, все технические и научные термины в данном документе имеют значение, общепринятое среди специалистов в области, к которой принадлежит изобретение. Все упомянутые по тексту публикации, патенты и патентные публикации полностью включены в настоящий документ посредством ссылки.

[00191] Очевидно, что раскрытое изобретение не ограничено конкретной методологией, протоколами и описанными материалами, поскольку они могут варьироваться. Также необходимо понимать, что терминология изобретения используется только для описания частных примеров осуществления изобретения и не ограничивает объем настоящего изобретения. Объем настоящего изобретения ограничен лишь пунктами формулы изобретения.

[00192] Специалистам понятны возможные эквиваленты конкретных описанных вариантов осуществления изобретения или специалисты смогут определить такие эквиваленты в ходе стандартных опытов. Подразумевается, что такие эквиваленты охватываются следующей формулой изобретения.

Формула изобретения

1. Жидкая препаративная форма, содержащая
 - (a) триазольный фунгицид и/или пиразольный фунгицид; и
 - (b) по меньшей мере, одно циклодекстриновое соединение.

2. Жидкая препаративная форма по п. 1, **отличающаяся тем**, что триазольный фунгицид выбран из группы, состоящей из азаконазола, битертанола, бромконазола, ципроконазола, диклобутразола, дифенокконазола, диниконазола, диниконазола-М, эпоксиконазола, этаконазола, фенбуконазола, флухинконазола, флусилазола, флутриафола, фурконазола, фурконазола-цис, гексаконазола, имибенконазола, ипконазола, метконазола, миклобутанила, паклобутразола, пенконазола, пропиконазола, протиокконазола, хинконазола, симекконазола, тебуконазола, тетраконазола, триадимефона, триадименола, тритиконазола, униконазола, униконазола-Р, вориконазола и 1-(4-хлорфенил)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)циклопентанола; и причем пиразольный фунгицид выбран из группы, состоящей из бензовиндифлупира, биксафена, флуиндапира, флуксапироксада, фураметпира, изопиразама, пенфлуфена, пентиопирада, пирифлуметофена, пирпропоина, рабензазола и седаксана.

3. Жидкая препаративная форма по п. 1 или 2, **отличающаяся тем**, что циклодекстриновое соединение представляет собой α -циклодекстрин, β -циклодекстрин, или γ -циклодекстрин.

4. Жидкая препаративная форма по п. 1 или 2, **отличающаяся тем**, что циклодекстриновое соединение представляет собой модифицированный циклодекстрин с одной или более заменами в гидроксильной группе.

5. Жидкая препаративная форма по п. 4, **отличающаяся тем**, что замена выбрана из группы, состоящей из алкильной группы, гидроксиалкильной группы, алкоксиалкильной группы, сульфоалкильной группы, сульфоалкилэфирной группы и группы сахара.

6. Жидкая препаративная форма по п. 5, **отличающаяся тем**, что модифицированный циклодекстрин выбран из группы, состоящей из

метилциклодекстрина, гидроксиэтилциклодекстрина, 2-гидроксипропилциклодекстрина, глюкозилциклодекстрина, сульфобутилциклодекстрина, сульфобутиловый эфир-циклодекстрина, глюкозилциклодекстрина и мальтозилциклодекстрина.

7. Жидкая препаративная форма по п. 1 или 2, **отличающаяся тем**, что циклодекстриновое соединение выбрано из группы, состоящей из γ -циклодекстрина, α -циклодекстрина, β -циклодекстрина, глюкозил- α -циклодекстрина, мальтозил- α -циклодекстрина, глюкозил- β -циклодекстрина, мальтозил- β -циклодекстрина, 2-гидрокси- β -циклодекстрина, 2-гидроксипропил- β -циклодекстрина (HP β CD), 2-гидроксипропил- γ -циклодекстрина, гидроксиэтил- β -циклодекстрина, метил- β -циклодекстрина, сульфобутиловый эфир- α -циклодекстрина, сульфобутиловый эфир- β -циклодекстрина, и сульфобутиловый эфир- γ -циклодекстрина, диметил- β -циклодекстрина (DM β CD), триметил- β -циклодекстрина (TM β CD), произвольно метилированного- β -циклодекстрина (RM β CD), гидроксиэтил- β -циклодекстрина (HE β CD), 3-гидроксипропил- β -циклодекстрина (3HP β CD), 2,3-дигидроксипропил- β -циклодекстрина (DHP β CD), 2-гидроксиизобутил- β -циклодекстрина (HIB β CD), сульфобутиловый эфир- β -циклодекстрина (SBE β CD), глюкозил- β -циклодекстрина (G1 β CD), мальтозил- β -циклодекстрина (G2 β CD), сульфозэтиловый эфир β -циклодекстрина и сульфопропиловый эфир β -циклодекстрина.

8. Жидкая препаративная форма по любому из предшествующих пунктов, дополнительно содержащая одно или более дополнительных агрохимически активных веществ.

9. Жидкая препаративная форма по п. 8, **отличающаяся тем**, что агрохимически активные вещества представляют собой один или более инсектицидов, нематоцидов, фунгицидов, регуляторов роста насекомых, регуляторов роста растений или стимуляторов роста растений.

10. Жидкая препаративная форма по п. 9, **отличающаяся тем**, что агрохимически активные вещества представляют собой один или более фунгицидов.

11. Жидкая препаративная форма по п. 10, **отличающаяся тем**, что один или более фунгицидов представляют собой ингибиторы дыхательной цепи в комплексе I или II, выбранные из группы, состоящей из бензовиндифлупира, биксафена, боскалида, карбоксина, флуопирама, флутоланила, флуксапироксада, фураметпира, Изофетамида, изопиразама (анти-эпимерного энантиомера 1R,4S,9S), изопиразама (анти-эпимерного энантиомера 1S,4R,9R), изопиразама (анти-эпимерного рацемата 1RS,4SR,9SR), изопиразама (смеси син-эпимерного рацемата 1RS,4SR,9RS и анти-эпимерного рацемата 1RS,4SR,9SR), изопиразама (син-эпимерного энантиомера 1R,4S,9R), изопиразама (син-эпимерного энантиомера 1S,4R,9S), изопиразама (син-эпимерного рацемата 1RS,4SR,9RS), пенфлуфена, пентиопирада, пирифлуметофена, Пиразифлумида, седаксана, 1,3-диметил-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)-1H-пиразол-4-карбоксамида, 1,3-диметил-N-[(3R)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамида, 1,3-диметил-N-[(3S)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамида, 1-метил-3-(трифторметил)-N-[2'-(трифторметил)бифенил-2-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамида, 2-фтор-6-(трифторметил)-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)бензамида, 3-(дифторметил)-1-метил-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)-1H-пиразол-4-карбоксамида, 3-(дифторметил)-1-метил-N-[(3R)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамида, 3-(дифторметил)-1-метил-N-[(3S)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамида, Флуиндапира, 3-(дифторметил)-N-[(3R)-7-фтор-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, 3-(дифторметил)-N-[(3S)-7-фтор-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, 5,8-дифтор-N-[2-(2-фтор-4-{[4-(трифторметил)пиридин-2-ил]окси}фенил)этил]хиназолин-4-амин, N-(2-циклопентил-5-фторбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-(2-трет-бутил-5-метилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-(2-трет-бутилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-(5-хлор-2-этилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-(5-хлор-2-изопропилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида, N-[(1R,4S)-9-(дихлорметилен)-1,2,3,4-тетрагидро-1,4-метаннафтален-5-ил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-

карбоксамид, N-[(1S,4R)-9-(дихлорметилен)-1,2,3,4-тетрагидро-1,4-метаннафтален-5-ил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-[1-(2,4-дихлорфенил)-1-метоксипропан-2-ил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-[2-хлор-6-(трифторметил)бензил]-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-[3-хлор-2-фтор-6-(трифторметил)бензил]-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-[5-хлор-2-(трифторметил)бензил]-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-N-[5-метил-2-(трифторметил)бензил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-фтор-6-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропил-5-метилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(5-фтор-2-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-N-(2-этил-4,5-диметилбензил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-N-(2-этил-5-фторбензил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-N-(2-этил-5-метилбензил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-N-(2-циклопропил-5-фторбензил)-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-N-(2-циклопропил-5-метилбензил)-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-циклопропил-N-(2-циклопропилбензил)-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид и пирпропоина.

12. Жидкая препаративная форма по п. 11, **отличающаяся тем**, что фунгицид представляет собой триазольный фунгицид, и ингибитор дыхательной цепи в комплексе I или II представляет собой пенфлуфен.

13. Жидкая препаративная форма по любому из предшествующих пунктов, **отличающаяся тем**, что циклодекстриновое соединение образует комплекс включения с триазольным или пиразольным фунгицидом и/или одним или более дополнительных агрохимически активных веществ.

14. Жидкая препаративная форма по п. 13, **отличающаяся тем**, что комплекс включения образуют путем растворения циклодекстринового соединения с триазольным или пиразольным фунгицидом и/или одним или более дополнительных агрохимически активных веществ в растворителе.

15. Жидкая препаративная форма по любому из предшествующих пунктов, **отличающаяся тем**, что

триазольный и/или пиразольный фунгицид находится в концентрации от около 0.1% до около 10% (мас./мас.); и

по меньшей мере, одно циклодекстриновое соединение находится в концентрации от около 1% до около 50% (мас./мас.).

16. Способ получения жидкой препаративной формы по любому из пп. 8 - 15 путем смешивания триазольного и/или пиразольного фунгицида, по меньшей мере, одного циклодекстринового соединения, агрохимически активного вещества, и, при необходимости, других добавок.

17. Способ подавления деградации триазольного и/или пиразольного фунгицида в жидкой препаративной форме, включающий:

(a) упаковку препаративной формы в подходящий контейнер;

(b) уменьшение воздействия кислорода на триазольный и/или пиразольный фунгицид в препаративной форме по сравнению с воздействием кислорода на триазольный и/или пиразольный фунгицид, когда препаративная форма контактирует с воздухом; и

(c) закрытие или герметизацию контейнера.

18. Способ по п. 17, **отличающийся тем**, что контейнер содержит мало свободного пространства или не содержит совсем.

19. Способ по п. 17 или 18, **отличающийся тем**, что контейнер способствует уменьшению или предотвращению диффузии кислорода.

20. Способ по любому из пп. 17 - 19, **отличающийся тем**, что воздействие кислорода на этапе (b) уменьшают за счет продувки свободного пространства и/или препаративной формы газом, содержащим меньше кислорода по сравнению с воздухом или не содержащим кислорода.

21. Способ по п. 20, **отличающийся тем**, что газ представляет собой водород, азот, гелий, неон, аргон, криптон, ксенон, радон, диоксид углерода, оксид азота, сероводород, низший алкан, галогеналкан, алкоксиалкан или их смесь.

22. Способ по п. 21, **отличающийся тем**, что газ представляет собой азот.

23. Способ по любому из пп. 17 - 22, **отличающийся тем**, что триазольный фунгицид выбран из группы, состоящей из азаконазола, битертанола, бромконазола, ципроконазола, диклобутразола, дифенокконазола, диниконазола, диниконазола-М, эпоксиконазола, этаконазола, фенбуконазола, флухинконазола, флусилазола, флутриафола, фурконазола, фурконазола-цис, гексакконазола, имибенконазола, ипконазола, метконазола, миклобутанил, паклобутразола, пенконазола, пропиконазола, протиокконазола, хинконазола, симекконазола, тебуконазола, тетраконазола, триадимефона, триадименола, тритиконазола, уникконазола, уникконазола-Р, вориконазола и 1-(4-хлорфенил)-2-(1Н-1,2,4-триазол-1-ил)циклопентанола; и пиразольный фунгицид выбран из группы, состоящей из бензовиндифлупира, биксафена, флуиндапира, флуксапироксада, фураметпира, изопиразама, пенфлуфена, пентиопирада, пирифлуметофена, пирапропоина, рабензазола и седаксана.

24. Закрытый контейнер, содержащий жидкую препаративную форму, содержащую триазольный или пиразольный фунгицид,

отличающийся тем, что воздействие кислорода на триазольный и/или пиразольный фунгицид в препаративной форме уменьшено по сравнению с воздействием кислорода на триазольный и/или пиразольный фунгицид, когда препаративная форма контактирует с воздухом, с помощью способа по любому из пп. 17 - 23.

25. Способ борьбы с вредителями растений или фитопатогенными грибами, включающий:

получение жидкой препаративной формы по любому из пп. 1 - 15 или контейнера, содержащего жидкую препаративную форму по п. 24;

получение препаративной формы для сельскохозяйственного применения или для применения в качестве биоцида; и

нанесение полученной препаративной формы на растение или место произрастания, нуждающееся в таком нанесении.

26. Жидкая препаративная форма по любому из пп. 1 - 15, **отличающаяся тем**, что деградацию триазольного и/или пиразольного фунгицида в жидкой препаративной форме подавляют в соответствии со способом по любому из пп. 17 - 23.

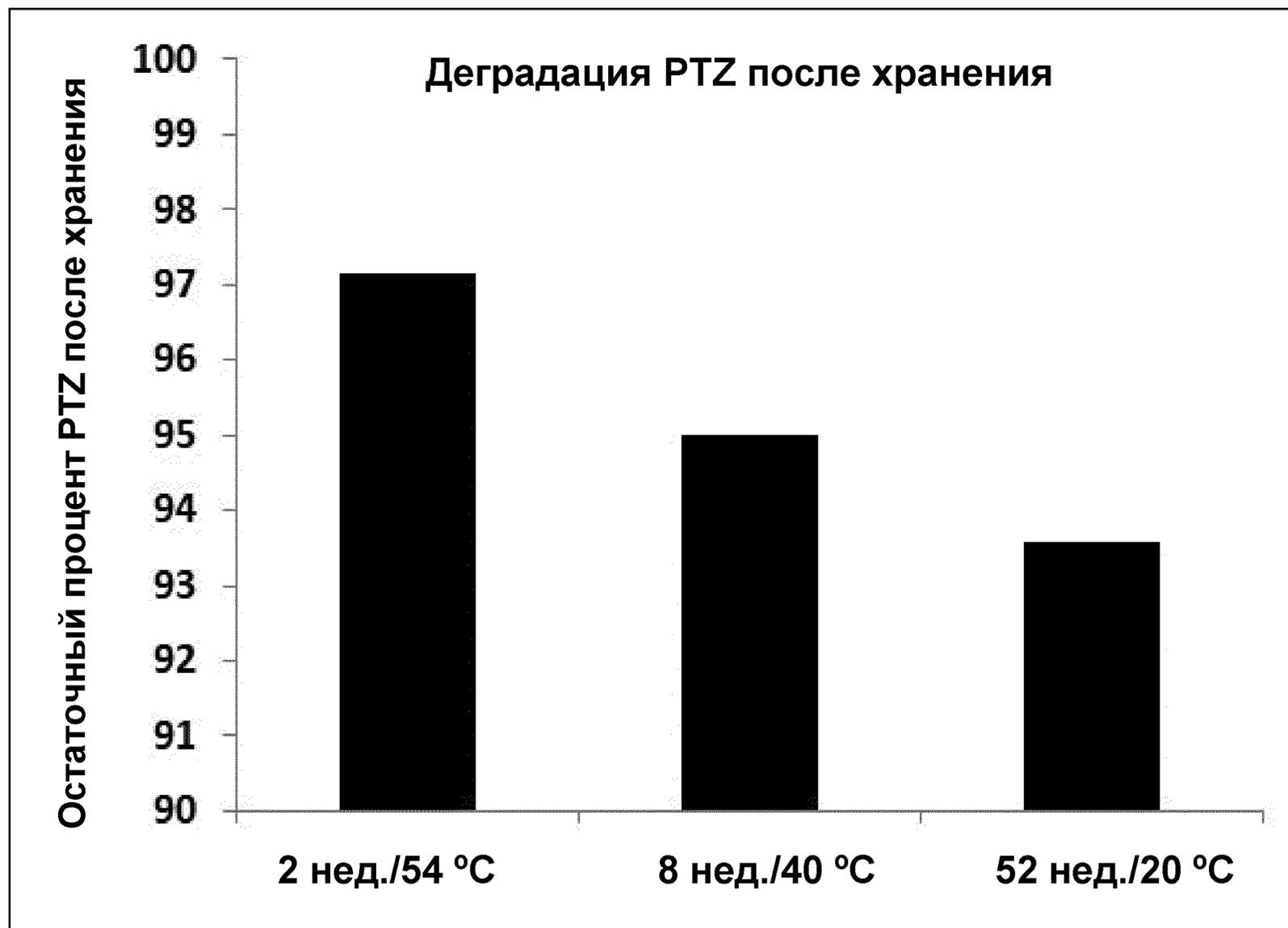
27. Жидкая препаративная форма по п. 1, **отличающаяся тем**, что фунгицид представляет собой смесь триазольного фунгицида и пиразольного фунгицида.

28. Жидкая препаративная форма по п. 27, **отличающаяся тем**, что триазольный фунгицид представляет собой протиоконазол, и пиразольный фунгицид представляет собой пенфлуфен.

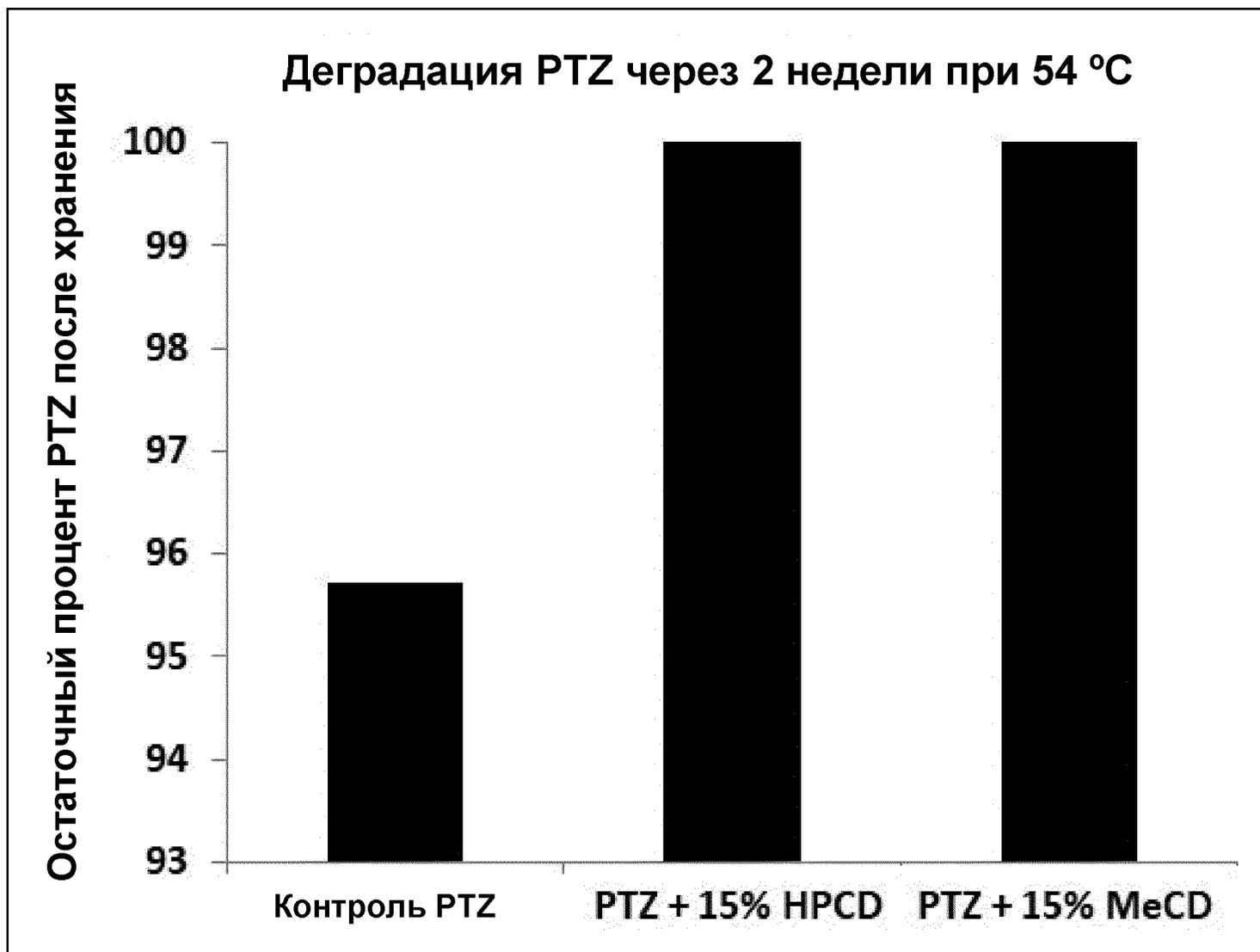
29. Жидкая препаративная форма по п. 1, которая представляет собой водную препаративную форму.

30. Жидкая препаративная форма по п. 29, которая представляет собой водную дисперсию.

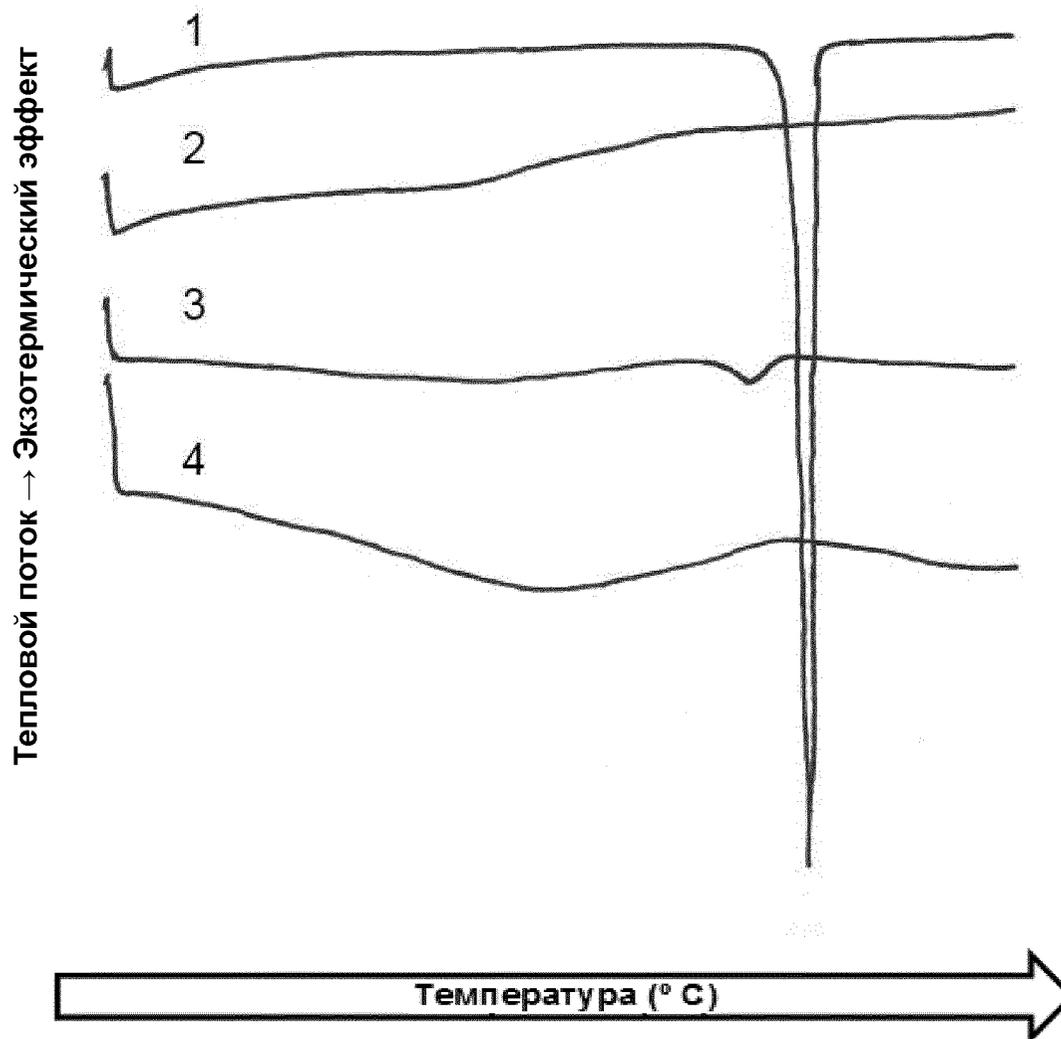
ФИГ. 1А



ФИГ. 1В



ФИГ. 2



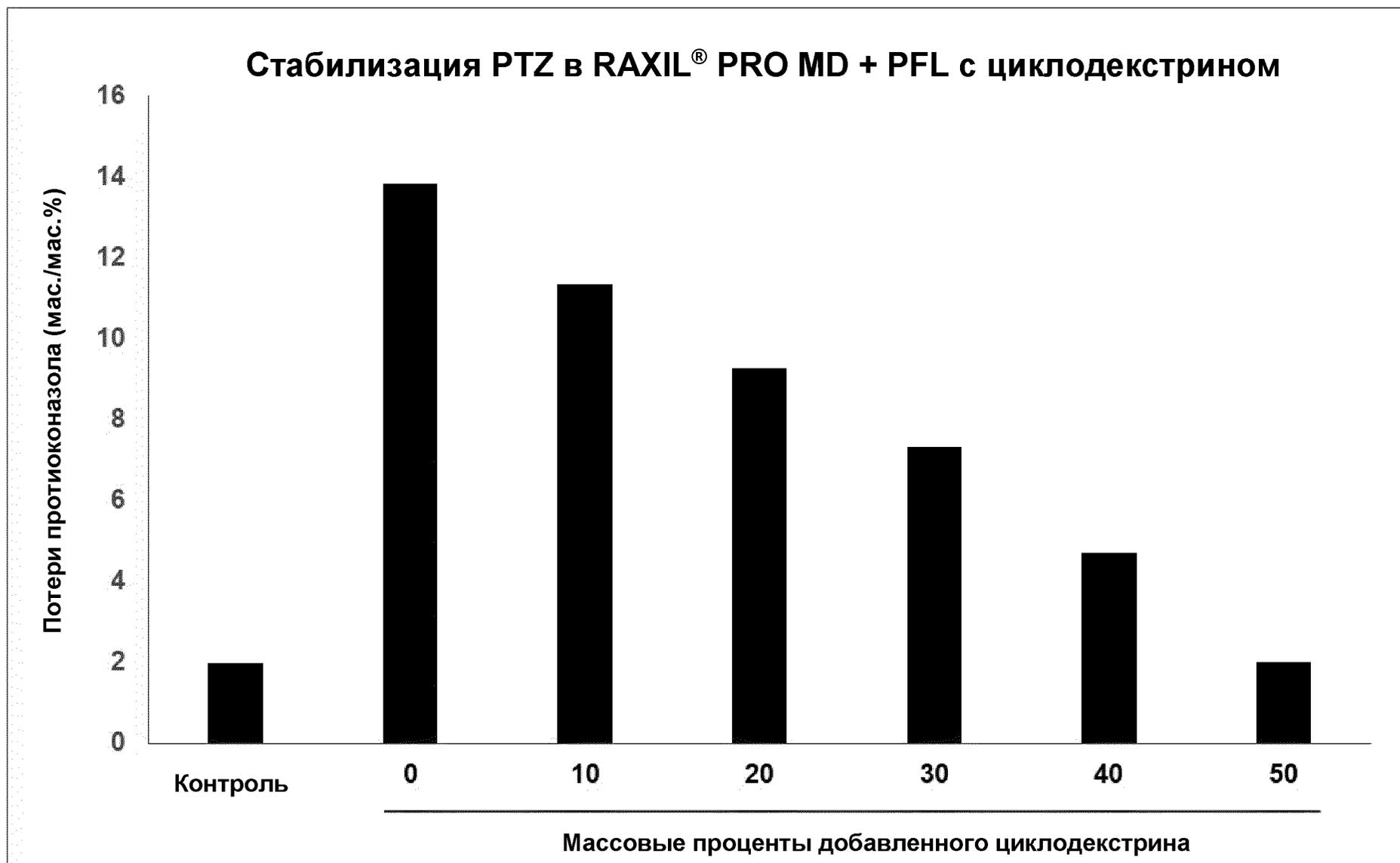
1 = только фунгициды

2 = только циклодекстрин

3 = физическая смесь

4 = комплекс включения

ФИГ. 3



ФИГ. 4

