



УКРАЇНА

(19) UA (11) 56150 (13) C2

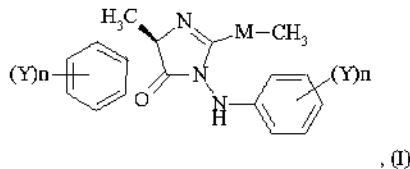
(51) 7 A01N43/50, A01N37/18

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІОПИС  
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД**(54) ФУНГІЦИДНА КОМПОЗИЦІЯ, ЩО МІСТИТЬ ПОХІДНЕ 2-ІМІДАЗОЛІН-5-ОНУ, СПОСІБ БОРОТЬБИ ПРОТИ ФІТОПАТОГЕННИХ ГРИБКІВ ТА ПРОДУКТ**

1

2

(21) 98063035  
 (22) 30 12 1997  
 (24) 15 05 2003  
 (46) 15 05 2003, Бюл. №5, 2003р  
 (86) PCT/FR97/02449, 30 12 1997  
 (72) Чазалет Мауріце, FR, Латорсе Марі-Паскаль, FR, Меркер Річард, FR  
 (73) АВЕНТІС КРОПСАЙНС С А, FR  
 (56) WO, A, 96 03044, 08 02 1996, EP, A, 0 753 258, 15 01 1997, EP, A, 0 800 629, 08 06 1994,  
 (57) 1 Фунгіцидна композиція, що містить сполуку (I) формули



де  
 М являє собою атом кисню або сірки,  
 n являє собою ціле число рівне 0 або 1,  
 Y являє собою атомом фтору або хлору, або радикал метил,  
 та сполуку (II)  
 N-[3'-(1'-хлоро-3'-метил-2'-оксопентан)]-3,5-дихлоро-4-метилбензамід (II),  
 співвідношення сполука (I)/сполука (II) лежить у межах від 0,01 до 50, переважно від 0,1 до 10  
 2 Фунгіцидна композиція за п 1, яка відрізняється тим, що сполука (I) являє собою (4S)-4-метил-2-метилтіо-4-феніл-1-феніламіно-2-імідазолін-5-он  
 3 Фунгіцидна композиція за пп 1 або 2, яка відрізняється тим, що співвідношення сполука (I)/сполука (II) обирають так, щоб досягти синергі-

чного ефекту

4 Фунгіцидна композиція за будь-яким з пп 1 - 3, яка відрізняється тим, що співвідношення сполука (I)/сполука (II) лежить у межах від 0,01 до 10, переважно від 0,2 до 5, ще більш переважно від 0,3 до 3

5 Фунгіцидна композиція за будь-яким з пп 1 - 4, яка відрізняється тим, що вона містить, крім сполук (I) і (II), прийнятний в сільському господарстві інертний носій та, у разі потреби, прийнятний в сільському господарстві поверхнево-активний засіб

6 Фунгіцидна композиція за будь-яким з пп 1 - 5, яка відрізняється тим, що вона містить від 0,5 до 95% комбінації сполуки (I) і сполуки (II)

7 Спосіб боротьби проти фітопатогенних грибків культур на місцевості, який полягає в обробці вказаної території сполукою (I) і сполукою (II), як їх визначено у п 1

8 Спосіб боротьби, з метою лікування або профілактики, проти фітопатогенних грибків культур, який відрізняється тим, що рослини, які підлягають лікуванню, обробляють ефективною та не фітотоксичною кількістю фунгіцидної композиції згідно з будь-яким з пп 1 - 6

9 Спосіб за п 8, який відрізняється тим, що фунгіцидну композицію застосовують шляхом розпилення рідини на поверхневі частини культур, які підлягають обробці

10 Спосіб за пп 8 або 9, який відрізняється тим, що кількість фунгіцидної композиції відповідає дозі сполуки (I), яка становить від 10 до 500г/га, переважно від 20 до 300г/га

11 Продукт, що містить сполуку формули (I) і сполуку формули (II) у вигляді комбінованого препарату для одночасного, окремого або послідовного використання у боротьбі проти фітопатогенних грибків культур на місцевості

Даний винахід стосується нових фунгіцидних

композицій, що містять 2-імідазолін-5-он, призна-

(13) C2

(11) 56150

(19) UA

чених зокрема для захисту культур. Він також стосується способу захисту культур проти грибкових хвороб.

Відомі, зокрема згідно заявці на європейський патент EP 551048, похідні сполуки від 2-імідазолін-5-онів, які мають фунгіцидну дію, що дозволяє запобігати росту і розвитку фітопатогенних грибків, які вражають або здатні вражати культуру.

Міжнародна заявка на патент WO 96/03044 також наводить деяку кількість фунгіцидних сполук, які містять 2-імідазолін-5-он в поєднанні з одним або декілька речовинами, які мають фунгіцидну активність.

Однак, завжди бажано поліпшувати засоби, що використовуються у сільському господарстві для боротьби проти грибкових хвороб культур, і зокрема проти мілдью.

Також завжди бажано скорочувати дози хімічних продуктів, які потрапляють у середовище для боротьби проти грибкових нападів на культури, зокрема скорочуючи дози застосування таких продуктів.

Нарешті, завжди бажано збільшувати кількість антигрибкових засобів у розпорядженні сільського господарства, з метою знаходження серед них краще пристосованого до конкретного застосування.

Отже, метою винаходу є надати нову фунгіцидну композицію, корисну для розв'язання вищезгаданих проблем.

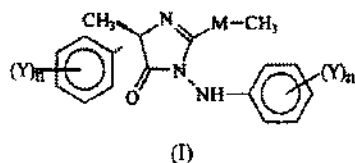
Іншою метою винаходу є запропонувати нову фунгіцидну сполуку, корисну для профілактики та лікування хвороб пасльонових.

Інша мета винаходу - запропонувати нову фунгіцидну сполуку, яка має поліпшену ефективність проти мілдью та/або альтернаріозу пасльонових.

Інша мета винаходу - запропонувати нову фунгіцидну сполуку, що має поліпшену ефективність проти мілдью та/або оїдіуму та/або ботритіозу винограду.

Було знайдено, що ці задачі можуть бути вирішені в сукупності або частково завдяки фунгіцидним композиціям згідно даного винаходу.

Таким чином, даний винахід стосується, по-перше, фунгіцидних композицій, що містять сполуку формули (I)



де

M представляє атом кисню або сірки,

n є ціле число рівне 0 або 1,

Y є атомом фтору або хлору, або метильним радикалом,

та сполуку (II), або N-[3'-(1'-хлоро-3'-метил-2'-оксопентан)]-3,5-дихлоро-4-метилбензамід,

співвідношення сполука(I)/сполука(II) лежить у проміжку від 0,01 до 50, переважно від 0,1 до 10.

Композиції згідно даного винаходу переважно застосовуються для боротьби зокрема проти мілдью пасльонових, таких як картопля або томати,

також проти мілдью і оїдіуму винограду.

Сполука(I) відома, зокрема із заявці на патент EP 629616.

Сполука(II) та її використання як фунгіциду описано в європейській заявці на патент EP 600629.

Співвідношення сполука(I)/сполука(II) визначається як вагове співвідношення цих двох сполук. Те саме стосується будь-якого співвідношення двох хімічних сполук, що далі згадуються в цьому тексті, якщо інше співвідношення спеціально не вказується.

Ці композиції помітно поліпшують головним чином відповідну дію ізольованої сполуки(I) і сполуки(II) для деякої кількості особливо шкідливих грибків у культурах, зокрема пасльонових, більш особливо для мілдью пасльонових, зберігаючи повну відсутність фототоксичності стосовно цих культур. Таким чином, виникає поліпшення спектра активності і можливість зменшувати відповідну дозу кожної активної речовини, що використовується. Легко зрозуміло, що з екологічних причин ця остання риса має особливе значення.

Віддають перевагу фунгіцидним композиціям згідно даного винаходу, в яких сполука(I) є сполукою формули(I), де M є атом сірки і n дорівнює 0, яка також зветься (4-S)-4-метил-2-метилтіо-4-феніл-1-феніламіно-2-імідазолін-5-он.

У сполуках згідно винаходу, співвідношення сполука(I)/сполука(II) переважно обирається так, щоб досягти синергічного ефекту. Під синергічним результатом розуміють зокрема такий, що визначений [Colby S. R. у статті "Calcul des responses synergiques et antagonistes des combinaisons herbicides. Розрахунок синергічних та антагоністичних відповідей гербіцидних сполук, опублікований у журналі Weeds, 1967, 15, p. 20 - 22] згадана стаття використовує формулу

$$E = X + Y - XY/100,$$

де E представляє очікуваний відсоток інгибування хвороби для композиції з двох фунгіцидів у певних дозах (наприклад рівних відповідно x та y),

X є відсотком інгибування хвороби, що спостерігається для сполуки(I) у певній дозі (рівній x),

Y є відсотком інгибування хвороби, що спостерігається для сполуки(II) у певній дозі (рівній y). Коли відсоток інгибування, що спостерігається для композиції, є більшим, чим E, це є синергічний результат.

Під синергічним результатом розуміють також визначений при застосуванні методу Tamme, ["Isoboles, a graphic representation of synergism in pesticides (Ізоболі, графічне представлення синергізму для пестицидів)"] Netherlands Journal of Plant Pathology, 70(1964), p. 73 - 80.]

Межі співвідношення сполука(I)/сполука(II), зазначені вище, ні яким чином не обмежують області винаходу, але скоріше є наочними, фахівець здатен здійснювати додаткові випробування щоб знайти інші значення співвідношення доз цих 2 сполук, для яких спостерігається синергічний ефект.

Композиції згідно винаходу, що включають сполуку(I) і сполуку(II), виявляють достовірні синергічні властивості.

Відповідно до одного з варіантів композицій

згідно даного винаходу, співвідношення сполука(I)/сполука(II) переважно лежить у межах від 0,01 до 10, більш переважно від 0,2 до 5, ще більш переважно від 0,3 до 3

Крім сполуки(I) і сполуки(II), композиції згідно даного винаходу містять прийнятний в сільському господарстві інертний носій й, у разі потреби, прийнятний в сільському господарстві поверхнево активний засіб. Надалі, під терміном активної речовини розуміють композицію сполуки(I) та сполуки(II), і наведені співвідношення, якщо не вказане інше, є співвідношеннями вага/вага.

Терміном "носіє", у даному тексті, позначають органічну або мінеральну речовину, природну або синтетичну, із яким поєднують активну речовину щоб полегшити її застосування на рослинах або на ґрунті. Цей носій є головним чином інертним і повинен бути придатним для сільського господарства, зокрема на культурах, що обробляються. Носій може бути твердим(зокрема глини, природні або синтетичні силікати, оксид кремнію, смоли, воски, тверді добрива) або рідким(зокрема вода, спирти, кетони, фракції нафти, ароматичні вуглеводні або парафіни, хлоровані вуглеводні, зріджені гази).

Поверхнево активний агент може бути емульгуювальним засобом, дисперсантом або змочуючим засобом іонного або нейонного типу. Можна назвати, наприклад, солі поліакрилових кислот, солі лігносульфонових кислот, солі фенолсульфонових або нафталенсульфонових кислот, поліконденсати оксиду етилену на жирних спиртах або на жирних кислотах або на жирних амінах, заміщені феноли(зокрема алкілфеноли або арилфеноли), солі ефірів сульфосукцинових кислот, похідні таурину(зокрема алкілтаурати), фосфорні ефіри поліоксидетілових спиртів або фенолів. Присутність принаймні одного поверхнево активного агента часто необхідно, тому що активна речовина та/або інертний носій не розчиняються у воді і тому що носієм для застосування є вода.

Ці композиції можуть містити також різні інші інгредієнти такі як, наприклад, колоїдні захисники, адгезивні засоби, загусники, тиксотропні агенти, засоби проникнення, стабілізатори, секвеструвальні засоби, пігменти, барвники, полімери.

Загалом, композиції згідно даного винаходу можуть бути поєднані з усіма твердими або рідкими доповненнями з використанням звичайних методів отримання агрономічних композицій.

Методи застосування відомі фахівцям і вони можуть використовуватися без опису в рамках даного винаходу. Можна назвати, наприклад, розпилення.

Серед композицій, можна називати, загалом, тверді або рідкі композиції.

Як тверді форми композицій, можна називати порошки для розсіювання або розпилювання(вміст активної речовини може становити до 100%) і гранули, зокрема такі, що отримані екструзією, пакуванням, просяканням гранульованого носія, грануляцією з порошкової основи(вміст активної речовини у таких гранулах становить від 1 до 80% для останніх випадків).

Композиції можуть також використовуватися у формі порошку для розсіювання, можна в такий

спосіб використовувати композицію, що включає 50г активної речовини, 10г тонко подрібненого оксиду кремнію, 10г органічного пігменту і 970г тальку, ці складові змішують і подрібнюють та застосовують суміш шляхом розсіювання.

Як рідкі форми композицій або такі, що призначені для перетворення на рідкі композиції перед застосуванням, можна називати розчини, зокрема розчинні у воді концентрати, емульгуювальні концентрати, емульсії, концентровані суспензії, аерозолі, змочувані порошки(або порошки для пудеризації), пасти, диспергуючі гранули.

Емульгуювальні або розчинні концентрати частіше включають від 10 до 80% активної речовини, готові для застосування емульсії або розчини містять від 0,01 до 20% активної речовини.

Наприклад, у більшості випадків, емульгуювальні концентрати можуть містити, коли це необхідно, від 2 до 20% придатних доповнень, таких як стабілізатори, поверхнево активні речовини, засоби для проникнення, інгібітори корозії, барвники або адгезивні засоби, згадані раніше.

Виходячи з цих концентратів, можна отримати шляхом розведення водою емульсії будь-якої бажаної концентрації.

Концентровані суспензії, також застосовні шляхом розпилення, готуються так, щоб одержати стійкий текучий продукт, що не осаджується, який звичайно містить від 10 до 75% активної речовини, від 0,5 до 15% поверхнево активних засобів, від 0,1 до 10% тиксотропних агентів, від 0 до 10% придатних добавок, таких як пігменти, барвники, протипінні засоби, інгібітори корозії, стабілізатори, агенти проникнення та адгезивні засоби, і як носій, воду або органічну рідину, в якій активна речовина є трохи або не розчинною певні тверді органічні речовини або мінеральні солі може бути розчинені в носії для підсилення седиментації або як антифризи для води.

Змочувані порошки(або порошки для пудеризації) звичайно готують так, щоб вони містили 20 - 95% активної речовини, і вони містять звичайно, крім твердого носія від 0 до 5% змочуючого засобу, від 3 до 10% дисперсанту і, коли це необхідно, від 0 до 10% одного або декількох стабілізуючих агентів та/або інші добавки, такі як пігменти, барвники, агенти проникнення, адгезивні речовини, або розпушуючі засоби, барвники і т.д.

Щоб одержати ці порошки для пудеризації або змочувані порошки, активні речовини ретельно змішують у відповідних міксерах із додатковими речовинами та подрібнюють за допомогою млинів або інших придатних подрібнювачів. Таким чином отримують порошки для пудеризації, перевагою яких є змочуваність та здатність суспендувати, ці порошки можна використовувати для приготування суспензії з водою в будь-якій бажаній концентрації.

Замість змочуваних порошків, можна отримати пасти. Умови й способи отримання та використання цих паст подібні до таких для змочуваних порошків або порошків для пудеризації.

Гранули для розсіювання звичайно отримують шляхом поєднання у відповідних пристроях для гранулювання із сполук типу змочуваного порошку.

Як вже згадувалося, дисперсії та водяні ему-

льсії, наприклад композиції, отримані шляхом розведення водою змочуваного порошку або емульгуювального концентрату згідно даного винаходу, включено до загальних об'єктів даного винаходу. Емульсії можуть бути типу вода-в-маслі або масло-у-воді та вони можуть мати густу консистенцію, схожу на "майонез".

Фунгіцидні композиції згідно з винаходом містять звичайно від 0,5 до 95% композиції сполуки(I) і сполуки(II).

Мова може йтися про концентровану композицію, тобто комерційний продукт, що поєднує сполуку(I) і сполуку(II). Мова може йтися також про розведену композицію, що готова для застосування на культурах, які потрібно обробляти. В останньому випадку розведення водою може бути здійснене, або виходячи з концентрованої комерційної композиції, яка містить сполуку(I) і сполуку(II) (ця суміш називається "готова для використання" або ще "ready mix", англійською мовою), або з суміші двох концентрованих комерційних композицій, кожна з яких містить сполуку(I) і сполуку(II), яка готується безпосередньо перед застосуванням (що англійською називається "tank mix").

Нарешті предметом винаходу є спосіб боротьби з метою лікування або профілактики проти фітопатогенних грибків культур, який характеризується тим, що рослини, які потребують лікування, обробляють ефективною та не фітотоксичною кількістю фунгіцидної композиції згідно винаходу.

Фітопатогенні грибки культур, з якими можна боротися, використовуючи цей спосіб, включають зокрема такі

групи ооміцетів

роду *Phytophthora*, такі як *Phytophthora infestans* (мільдю пасльонових, зокрема картоплі або помідорів),

роду *Peronosporaceae*, зокрема *Plasmopara viticola* (мільдю винограду), *Plasmopara halstedii* (мільдю соняшника), *Pseudoperonospora* (зокрема мільдю гарбузових та хмелю), *Bremia lactucae* (мільдю салату - латук), *Peronospora tabacinae* (мільдю тютюну), *Peronospora parasitica* (мільдю капусти),

групи аделоміцетів

роду *Alternaria*, наприклад *Alternaria solani* (альтернاریоз пасльонових, і зокрема помідорів та картоплі),

роду *Guignardia* зокрема *Guignardia bidwellii* (чорна гниль винограду),

роду *Oidium*, наприклад оїдіум винограду (*Uncinula necator*), оїдіум овочевих культур, наприклад *Erysiphe polygoni* (оїдіум хрестоцвітних), *Leveillula taurica*, *Erysiphe cichoracearum*, *Sphaerotheca fuliginea* (оїдіум гарбузових, складноцвітних, помідорів), *Erysiphe communis* (оїдіум буряку та капусти), *Erysiphe pisi* (оїдіум гороху, люцерни), *Erysiphe polyphaga* (оїдіум квасолі й огірка), *Erysiphe umbelliferarum* (оїдіум зонтичних, зокрема моркви), *Sphaerotheca humuli* (оїдіум хмелю).

Під "застосовують до рослин, які потребують лікування" у даному контексті розуміють, що фунгіцидні композиції згідно з даним винаходом можуть застосовуватися з використанням різних способів обробки, таких як

розпилення на поверхневі частини названих

рослин рідини, що містить одну з названих композицій,

посипання, введення гранул або порошоків у ґрунт, поливання, навколо названих рослин, а також у випадку дерев - ін'єкція або фарбування.

Розпилення рідини на поверхневі частини культур, які потрібно обробляти, є переважним способом обробки.

Під "ефективною та не фітотоксичною кількістю", розуміють кількість композиції згідно з винаходом, яка достатня для контролювання або руйнування грибків, що присутні або здатні з'являтися на культурі, не викликаючи у вищезгаданих культурах жодного симптому фітотоксичності. Така кількість може змінюватися в широких межах відповідно до грибка, з яким борються, до типу культури, кліматичних умов і природи сполуки(I), яка входить до складу фунгіцидної композиції згідно з винаходом. Цю кількість може встановити фахівець за допомогою систематичних польових випробувань.

У звичайних умовах сільськогосподарської практики гарні результати виявляє кількість фунгіцидної композиції згідно з винаходом, яка відповідає дозі сполуки(I), що становить від 10 до 500г/га, переважно від 20 до 300г/га.

Згідно з винаходом, кількість фунгіцидної композиції переважно відповідає дозі сполуки(II), що становить від 50 до 500г/га, переважно від 100 до 300г/га.

Наступний приклад лише ілюструє винахід і ніяким чином не обмежує його.

У цьому прикладі, під вказаною сполукою(II) розуміють (4-S)-4-метил-2-метилтіо-4-феніл-1-феніламіно-2-імідазолін-5-он.

Приклад 1. Випробування на відкритому полі композиції, що містить сполуки(I) та(II) проти мільдю картоплі (*Phytophthora infestans*).

Використовують композицію, що містить сполуку(I) у формі концентрованої суспензії в концентрації 500г/л та композицію, що містить сполуку(II) у формі концентрованої суспензії в концентрації 240г/л.

Ці дві композиції змішують так, щоб отримане співвідношення сполука(I)/сполука(II) становило 1 та 1,5.

Суміш розводять водою в розрахунку 800л/га на поле картоплі і застосовують через 40 днів після посадки бульб. Дози, що застосовуються

для співвідношення 1 150г/га для сполуки(I) і 150г/га для сполуки(II),

для співвідношення 1,5 150г/га для сполуки(I) і 100г/га для сполуки(II).

Це застосування повторюється ще 6 разів протягом 7 днів.

Через два дні після першого застосування, приступають до зараження шляхом розпилення спор *Phytophthora infestans*.

За результатами починають спостерігати через 22 дні після сьомого застосування. Для цього візуально оцінюють (стосовно необробленої ділянки, але також зараженої) зараження C (або ступінь впливу) виражене у частині поверхні листя (вираженої в процентах), яка покрита чорними плямами, що відповідає нападу хвороби.

Ефективність E обчислюють відповідно до

формули Abbott

Отримали чудові результати ефективності з синергчним ефектом для отримання приблизно

половини ефективності, до сусідньої ділянки, що оброблялася манкозебом, необхідно було застосувати 1600г/га речовини