



УКРАЇНА

(19) UA (11) 84959 (13) C2
(51) МПК
A01N 43/56 (2006.01)

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ

ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) СПОСІБ ТА КОМПОЗИЦІЯ ДЛЯ БОРОТЬБИ З ФІТОПАТОГЕННИМИ ХВОРОБАМИ КОРИСНИХ РОСЛИН АБО МАТЕРІАЛУ ДЛЯ РОЗМНОЖЕННЯ, МАТЕРІАЛ ДЛЯ РОЗМНОЖЕННЯ

1

2

(21) а200702471

(22) 11.08.2005

(24) 10.12.2008

(86) PCT/EP2005/008752, 11.08.2005

(31) 0418048.5

(32) 12.08.2004

(33) GB

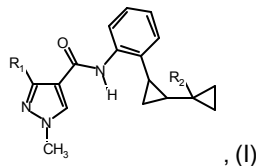
(46) 10.12.2008, Бюл.№ 23, 2008 р.

(72) ВАЛЬТЕР ХАРАЛЬД, DE/CH, ЦОЙН РО-
НАЛЬД, DE/CH, ЕРЕНФРОЙНД ЙОЗЕФ, AT/CH,
ТОБЛЕР ХАНС, КОРСІ КАМІЛЛА, IT/CH, ЛАМБЕРТ
КЛЕМЕНС, DE/CH

(73) СІНГЕНТАПАРТІСІПЕЙШНС АГ

(56) WO 03074491, А, 12.09.2003

(57) 1. Спосіб боротьби з фітопатогенними хворо-
бами корисних рослин або матеріалу для розмно-
ження цих рослин, який включає нанесення на
зазначений матеріал для розмноження рослин
фунгіцидно ефективною кількістю сполуки форму-
ли I



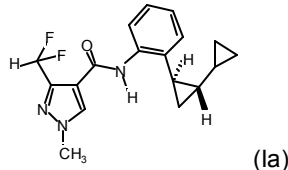
у якій

R₁ означає трифторметил або дифторметил,R₂ означає водень або метил;

або таутомеру такої сполуки.

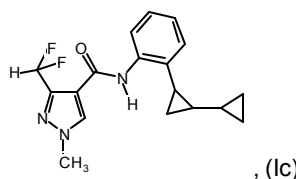
2. Спосіб за п.1, у якому сполуку формули I, у якій
R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень,
наносять на матеріал для розмноження рослин.

3. Спосіб за п.1, у якому рацемічну сполуку фор-
мули Ia (транс)

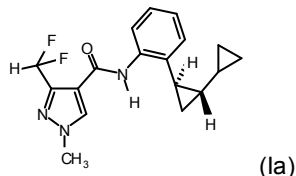


наносять на матеріал для розмноження рослин.

4. Спосіб за п.1, у якому рацемічну сполуку фор-
мули Ic



у якій вміст рацемічної сполуки формули Ia (транс)

становить від 65 до 99 мас. %, наносять на мате-
ріал для розмноження рослин.

5. Спосіб за п.1, у якому матеріал для розмножен-
ня корисних рослин являє собою насіння корисних
рослин.

6. Спосіб боротьби з фітопатогенними хворобами
корисних рослин або матеріалу для розмноження
цих рослин, який включає нанесення на зазначе-
ний матеріал для розмноження рослин фунгіцидно
ефективною кількістю композиції для захисту мате-
ріалу для розмноження рослин, яка включає спо-
луку формули I за п.1 разом з придатним для неї
носієм.

7. Композиція для захисту матеріалу для розмно-
ження рослин, яка включає сполуку формули I за
п.1 разом з придатним для неї носієм.

8. Композиція для захисту матеріалу для розмно-
ження рослин за п.7, яка додатково включає заба-
рвлювальний агент.

9. Матеріал для розмноження рослин, оброблений
композицією для захисту матеріалу для розмно-
ження рослин за п.7.

10. Матеріал для розмноження рослин, обробле-
ний композицією для захисту матеріалу для роз-
множення рослин за п.8.

11. Спосіб захисту матеріалу для розмноження
рослин і органів рослин, що виростають пізніше,
від ураження фітопатогенними хворобами, який
включає нанесення на зазначений матеріал для
розмноження рослин фунгіцидно ефективною кіль-
кості сполуки формули I за п.1.

(13) C2

(11) 84959

(19) UA

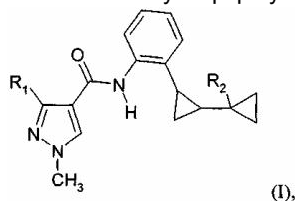
Даний винахід стосується способу захисту корисних рослин або матеріалу для розмноження рослин, такого як насіння, за допомогою фунгіцидів, призначеного для боротьби з фітопатогенними хворобами, композицій для захисту матеріалу для розмноження рослин, які включають зазначений фунгіцид, і матеріалу для розмноження рослин, обробленому зазначеними композиціями.

Захист корисних рослин або матеріалу для розмноження цих рослин шляхом нанесення пестицидів на матеріал для розмноження рослин і спеціалізованим способом застосування пестицидів, що відповідає необхідності зменшення впливу на навколишнє середовище та персонал у порівнянні і позакореневим або здійснюваним у ґрунт внесенням пестицидів.

З [WO 03/074491] відомо, що деякі похідні о-циклопропілкарбоксаніліду мають біологічну активність щодо фітопатогенних грибів. В [WO 03/074491] також описані способи боротьби із зараженням культурних рослин фітопатогенними мікроорганізмами шляхом нанесення зазначених похідних о-циклопропілкарбоксаніліду на рослини, на їх частини або на місце їх зростання. Зазначені описані способи являють собою, наприклад, позакореневе внесення, внесення дощуванням місця зростання рослин рідким препаратом, внесення грануляту в ґрунт, внесення грануляту в поля затоплюваної культури, такі як затоплювані рисові поля, та обробку насіння. В [WO 03/074491] на стор.26 опису] особливо відзначено, що із зазначених способів кращим способом внесення є позакореневе внесення.

Відповідно до винаходу несподівано було встановлено, що особлива підгрупа зазначених похідних орто-циклопропілкарбоксаніліду є особливо придатною для внесення шляхом обробки насіння.

Тому даний винахід стосується способу боротьби з фітопатогенними хворобами корисних рослин або матеріалу для розмноження цих рослин, який включає нанесення на зазначений матеріал для розмноження рослин фунгіцидно ефективної кількості сполуки формули I



у якій
R₁ означає трифторметил або дифторметил або

R₂ означає водень або метил; або таутомеру такої сполуки.

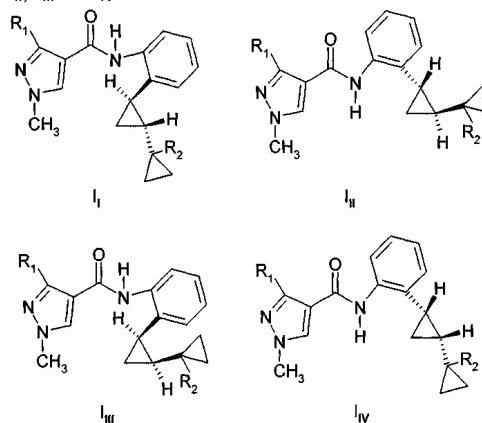
Спосіб, пропонується у даному винаході, є особливо придатним для підвищення врожайності і/або якості корисних рослин, такої як вихід культурних рослин з одиниці площі.

Тому даний винахід також стосується способу захисту матеріалу для розмноження рослин і органів, які виростають пізніше, від ураження фітопатогенними хворобами, і спосіб включає нанесення

на зазначений матеріал для розмноження фунгіцидно ефективної кількості сполуки формули I.

Тому даний винахід також стосується способу покращення характеристик росту рослини, і спосіб включає нанесення на зазначений матеріал для розмноження фунгіцидно ефективної кількості сполуки формули I.

Сполуки формули I існують у різних стереоізомерних формах, які представлені формулами I_I, I_{II}, I_{III} та I_{IV}:



у яких R₁ та R₂ є такими, як визначено для формули I. Способи, пропонується в даному винаході, включають нанесення всіх таких стереоізомерів і їх сумішей на матеріал для розмноження рослин у будь-якому співвідношенні.

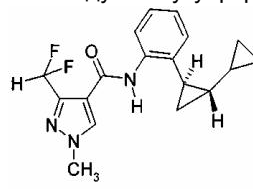
У кращому варіанті здійснення даного винаходу сполуку формули I, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, наносять на матеріал для розмноження рослин.

У кращому варіанті здійснення даного винаходу сполуку формули I, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає метил, наносять на матеріал для розмноження рослин.

У кращому варіанті здійснення даного винаходу сполуку формули I, у якій R₁ означає трифторметил та R₂ означає водень, наносять на матеріал для розмноження рослин.

У кращому варіанті здійснення даного винаходу сполуку формули I, у якій R₁ означає трифторметил та R₂ означає метил, наносять на матеріал для розмноження рослин.

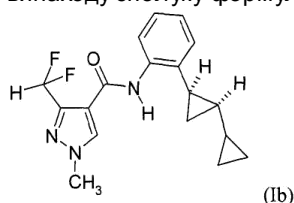
В іншому кращому варіанті здійснення даного винаходу сполуку формули Ia (транс)



яка являє собою сполуку формули I_I, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень; сполуку формули I_{III}, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, або суміш у будь-якому співвідношенні сполуки формули I_I, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, та сполуки формули I_{III}, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, наносять на матеріал для розмноження рослин.

У цьому варіанті здійснення даного винаходу перевага віддається варіанту здійснення, у якому рацемічну сполуку формули Ia, яка означає рацемічну суміш сполуки формули II, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, та сполуки формули I_{III}, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, наносять на матеріал для розмноження рослин.

В іншому кращому варіанті здійснення даного винаходу сполуку формули Ib (цис)

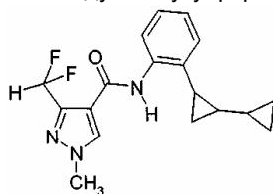


(Ib)

яка являє собою сполуку формули I_{III}, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень; сполуку формули I_{IV}, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, або суміш у будь-якому співвідношенні сполуки формули I_{III}, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, та сполуки формули I_{IV}, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, наносять на матеріал для розмноження рослин.

У цьому варіанті здійснення даного винаходу перевага віддається варіанту здійснення, у якому рацемічну сполуку формули Ib, яка означає рацемічну суміш сполуки формули I_{III}. У якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, та сполуки формули I_{IV}, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, наносять на матеріал для розмноження рослин.

В іншому кращому варіанті здійснення даного винаходу сполуку формули Ic



(Ic)

де відношення кількості рацемічних сполук формули Ia, яка означає рацемічну суміш сполук формули I_I, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, та сполук формули I_{III}, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, до кількості рацемічних сполук формули Ib, яка означає рацемічну суміш сполук формули I_{III}, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, та сполук формули I_{IV}, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, становить від 1:1 до 100:1, наносять на матеріал для розмноження рослин.

У зазначеному варіанті здійснення придатні відношення кількості рацемічних сполук формули Ia, яка означає рацемічну суміш сполук формули I_I, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, та сполук формули I_{III}, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, до кількості рацемічних сполук формули Ib, яка означає рацемічну суміш сполук формули I_{III}, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, та сполук формули I_{IV}, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, становить від 1:1 до 100:1, наносять на матеріал для розмноження рослин.

чає водень, є такими відношеннями, як 1:1, 2:1, 3:1, 4:1, 5:1, 6:1, 7:1, 8:1, 9:1, 10:1, 20:1, 50:1 або 100:1. Кращими є відношення від 2:1 до 100:1, більш кращими - від 4:1 до 10:1.

В іншому кращому варіанті здійснення даного винаходу сполуку формули Ic, у якій вміст рацемічних сполук формули Ia, яка означає рацемічну суміш сполук формули I_I, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, та сполук формули I_{III}, у якій R₁ означає дифторметил та R₂ означає водень, становить від 65 до 99мас.%, наносять на матеріал для розмноження рослин.

У даному винаході "рацемічна суміш" двох енантіомерів або "рацемічна сполука" означає суміш двох енантіомерів у відношенні, що практично становить 50:50.

Покращення характеристик росту (або зростання) рослини може проявлятися різним чином, але в остаточному підсумку воно приводить до кращого рослинного продукту. Воно може, наприклад, проявлятися в підвищенні врожайності і/або поліпшенні потужності рослини або якості зібраного рослинного продукту.

При використанні в даному винаході вираз "підвищення врожайності" рослини означає збільшення врожайності рослинного продукту на вимірну кількість у порівнянні із урожайністю того ж рослинного продукту, одержаного за таких же умов, але без застосування способу, пропонованого в даному винаході. Краще, щоб урожайність збільшилася не менш ніж приблизно на 0,5%, більш краще, щоб збільшення склало не менш ніж приблизно 2%, і ще більш краще, щоб воно склало приблизно 4% або більше. Урожайність можна виразити у вигляді маси або об'єму рослинного продукту у перерахунку на певну величину. Зазначена величина може бути часом, посівною площею, масою отриманих рослин, кількістю використаної сировини й т.п.

При використанні в даному винаході вираз "поліпшення потужності" рослини означає збільшення показника потужності, або щільності (кількості рослин на одиницю площі), або висоти рослини, або покращення зімкнутості пологів рослин, або зовнішнього вигляду (таке як більш зелений колір листя), або розвитку кореневої системи, або схожості, або вмісту білка, або посилення пагоноутворення, або збільшення пластинки листка, або меншу кількість опалих нижніх листків, або утворення більш сильних пагонів, або потребу в меншій кількості добрив, або потребу в меншій кількості насіння, або більш значну продуктивність пагонів, або більш раннє цвітіння, або більш раннє дозрівання зерна, або менше полягання рослин, або посилення росту пагонів, або раннє проростання, або будь-яку комбінацію цих факторів, або будь-які інші переваги, відомі спеціалісту в даній галузі техніки, що відбувається на вимірну або помітну кількість у порівнянні з тим же фактором для рослини, вирощеної за таких же умов, але без застосування способу, пропонованого в даному винаході.

Якщо зазначено, що спосіб може "поліпшити врожайність і/або потужність" рослини, то спосіб, пропонований у даному винаході, приведе до по-

кращення або врожайності, як це описано вище, або потужності рослини, як це описано вище, або і урожайності, і потужності рослини.

Сполуку формули I також можна використовувати для обробки продуктів, що зберігаються, таких як зерно, для захисту від фітопатогенних хвороб.

Способи, пропонувані в даному винаході, є особливо ефективними для захисту корисних рослин або матеріалу для розмноження цих рослин від фітопатогенних грибів, що належать до наступних класів: аскоміцетів (наприклад, родів *Cochliobolus*, *Colletotrichum*, *Fusarium*, *Gaeumannomyces*, *Giberella*, *Monographella*, *Microdochium*, *Penicillium*, *Phoma*, *Pyricularia*, *Magnaporthe*, *Septoria*, *Pseudocercospora*, *Tapesia* та *Thielaviopsis*); базидіоміцетів (наприклад, родів *Phakopsora*, *Puccinia*, *Rhizoctonia*, *Thanatephorus*, *Sphacelotheca*, *Tilletia*, *Typhula* та *Ustilago*); *Fungi imperfecti* (також відомі, як дейтероміцети; наприклад, родів *Ascochyta*, *Diplodia*, *Erysiphe*, *Fusarium*, *Helminthosporium*, *Phomopsis*, *Pyrenophora* та *Verticillium*); і зігоміцетів (наприклад, роду *Rhizopus*).

У контексті даного винаходу "корисні рослини" звичайно включають наступні види рослин: злаки, такі як пшениця, ячмінь, жито й овес; буряк, такий як цукровий буряк та кормовий буряк; бобові рослини, такі як боби, сочевиця, горох і соя; олійні рослини, такі як рапс, гірчиця, мак, соняшник, ріцина та земляний горіх; огіркові культури, такі як кабачки, огірки та дині; волокнисті рослини, такі як бавовна, льон, коноплі та джут; овочі, такі як шпинат, салат-латук, спаржа, капуста, морква, луки, томати, картопля, гарбузи та паприка; лаврові, такі як авокадо, і камфорний лавр; кукурудзу; тютюн; рис; дерен і декоративні рослини, такі як квіти, чагарники, широколисті дерева та вічнозелені рослини, наприклад, хвойні дерева. Цей перелік не є обмежуючим.

Термін "корисні рослини" слід розуміти, як такий, що включає й корисної рослини, яким надано стійкості до гербіцидів, таким як бромоксініл, або до класів гербіцидів (таким як, наприклад, інгібітори HPPD, інгібітори ALS, наприклад, примісульфурон, просульфурон і трифлорисульфурон, інгібітори EPSPS (5-енолпіровілшкімат-3-фосфатсинтаза), інгібітори ГС (глутамінсинтетаза)) за допомогою звичайних методик селекції або генної інженерії. Прикладом культури, якій за допомогою звичайних методик селекції (мутагенезу) надано стійкості, наприклад, до імідазолінонів, наприклад, імазамоксу, є суріпиця Clearfield® (канола). Приклади культур, яким за допомогою методик генної інженерії надано стійкості до гербіцидів або класів гербіцидів, включають сорти кукурудзи, стійкі до гліфозату та глюфозинату, які є у продажу під торговельними назвами RoundupReady®, Herculex I® та LibertyLink®.

Термін "корисні рослини" слід розуміти, як такий, що включає й корисної рослини, які шляхом використання методики на основі рекомбінантної ДНК змінені таким чином, що вони здатні синтезувати один або більшу кількість токсинів, які здійснюють селективний вплив, таких, для яких відомо,

наприклад, що вони виробляються бактеріями, що продукують токсини, особливо роду *Bacillus*.

Токсини, які можуть вироблятися такими трансгенними рослинами, включають, наприклад, інсектицидні білки, наприклад, інсектицидні білки з *Bacillus cereus* або *Bacillus popilliae*; або інсектицидні білки з *Bacillus thuringiensis*, такі як δ -ендотоксини, наприклад, CryI(A)(b), CryI(A)(c), CryIF, CryIF(a2), CryII(A)(b), CryII(A), CryII(B)(b1) або Cry9c, або рослинні інсектицидні білки (VIP), наприклад, VIP1, VIP2, VIP3 або VIP3A; або інсектицидні білки бактерій, що колонізують нематоди, наприклад, *Photorhabdus* spp або *Xenorhabdus* spp, такі як *Photorhabdus luminescens*, *Xenorhabdus nematophilus*; токсини, які продукуються тваринами, такі як токсини скорпіона, токсини павукоподібних, токсини ос та інші специфічні для комах нейротоксини; токсини, які продукуються грибами, такі як токсини *Streptomyces*; лектини рослин, такі як лектини гороху, лектини ячменю та лектини проліску; аглютиніни; інгібітори протеїнази, такі як інгібітори трипсину, інгібітори серинпротеази, інгібітори пататину, цистатину, папаїну; активуючі рибосоми, білки (RIP), такі як рицин, кукурудзи-RIP, абрин, луффінін, сапонін і бріодин; метаболічні ферменти стероїдів, такі як 3-гідроксистероїдоксидидаза, екдистероїд-UDP-глікозилтрансфераза, холестериноксидази, інгібітори екдизону, HMG-CoA-редуктаза, блокатори іонних каналів, такі як блокатори натрієвих і кальцієвих каналів, ювенільна гормональна естераза, рецептори діуретичних гормонів, стильбенсинтаза, бібензилсинтаза, хітинази та глюканази.

У контексті даного винаходу під δ -ендотоксинами слід розуміти, наприклад, CryI(A)(b), CryI(A)(c), CryIF, CryIF(a2), CryII(A)(b), CryII(A), CryII(B)(b1) або Cry9c, або рослинні інсектицидні білки (VIP), наприклад, VIP1, VIP2, VIP3 або VIP3A, а також явно гібридні токсини, укорочені токсини та модифіковані токсини. Гібридні токсини рекомбінантно продукуються за допомогою нової комбінації різних доменів цих білків [див., наприклад, WO 02/15701]. Прикладом укороченого токсину є укорочений CryI(A)(b), який виробляється кукурудзою Bt11, що випускається фірмою Syngenta Seeds SAS, як це описано нижче. У випадку модифікованих токсинів замінюється одна або більша кількість амінокислот природного токсину. При таких замінах амінокислот бажано вставляти в токсин послідовності розпізнавання протеази, що є природною, як, наприклад, у випадку CryIIIA055, у токсин CryIIIA вставляють послідовність розпізнавання катепсину-D [див. WO 03/018810].

Приклади таких токсинів або трансгенних рослин, здатних синтезувати такі токсини, розкриті, наприклад, в [EP-A-0374753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0427529, EP-A-451878 та WO 03/052073].

Способи одержання таких трансгенних рослин звичайно відомі спеціалісту в даній галузі техніки та описані, наприклад, у зазначені вище публікаціях. Дезоксирибонуклеїнові кислоти типу CryI і їх одержання описане, наприклад, в [WO 95/34656, EP-A-0367474, EP-A-0401979 та WO 90/13651].

Токсин, що міститься в трансгенних рослинах, надає рослинам стійкості щодо шкідливих комах. Такі комахи можуть зустрічатися в будь-якій таксономічній групі комах, але особливо часто вони зустрічаються серед жуків (твердокрилих), двокрилих комах (двокрилих) і метеликів (лускокрилих).

Трансгенні рослини, які містять один або більшу кількість генів, які кодують стійкість до комах та експресують один або більшу кількість токсинів, відомі та деякі з них є у продажу. Прикладами таких рослин є: YieldGard® (сорт кукурудзи, що експресує токсин CryI(A(b))); YieldGard Rootworm® (сорт кукурудзи, що експресує токсин CryIII(B(b1))); YieldGard Plus® (сорт кукурудзи, що експресує токсини CryI(A(b)) та CryIII(B(b1))); Starlink® (сорт кукурудзи, що експресує токсин Cry9(c)); Herculex I® (сорт кукурудзи, що експресує токсин CryI(F(a2)) і фермент фосфінотрицин-N-ацетилтрансферази (PAT) для надання стійкості до гербіциду глүфосинат-амонію); NuCOTN 33B® (сорт бавовни, що експресує токсин CryI(A(c))); Bollgard I® (сорт бавовни, що експресує токсин CryI(A(c))); Bollgard II® (сорт бавовни, що експресує токсини CryI(A(c)) та CryII(A(b))); VIPCOT® (сорт бавовни, що експресує токсин VIP); NewLeaf® (сорт картоплі, що експресує токсин CryII(A)); NatureGard® та Protecta®.

Іншими прикладами таких трансгенних культур є:

1. Кукурудза Bt11, яка випускається фірмою Syngenta Seeds SAS, розташованою за адресою: Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France, реєстраційний номер C/FR/96/05/10. Генетично модифікована Zea mays, якій надано стійкості до нападу метелика кукурудзяного (*Ostrinia nubilalis* та *Sesamia nonagrioides*) шляхом трансгенного експресування укороченого токсину CryI(A(b)). Кукурудза Bt11 також трансгенно експресує фермент PAT для надання стійкості до гербіциду глүфосинат-амонію.

2. Кукурудза Bt176, що випускається фірмою Syngenta Seeds SAS, розташованою за адресою: Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France, реєстраційний номер C/FR/96/05/10. Генетично модифікована Zea mays, якій надано стійкості до нападу метелика кукурудзяного (*Ostrinia nubilalis* і *Sesamia nonagrioides*) шляхом трансгенного експресування токсину CryI(A(b)). Кукурудза Bt176 також трансгенно експресує фермент PAT для надання стійкості до гербіциду глүфосинат-амонію.

3. Кукурудза MIR604, що випускається фірмою Syngenta Seeds SAS, розташованою за адресою: Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France, реєстраційний номер C/FR/96/05/10. Кукурудза, якій надано стійкості до комах шляхом трансгенного експресування модифікованого токсину CryII(A). Цей токсин є токсином Cry3A055, модифікованим шляхом вставки послідовності розпізнавання катепсин-Б-протеази. Одержання таких трансгенних рослин кукурудзи описане в [WO 03/018810].

4. Кукурудза MON 863, що випускається фірмою Monsanto Europe S.A., розташованою за адресою: 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium, реєстраційний номер C/DE/02/9.

MON 863 експресує токсин CryIII(B(b1)) і має стійкість щодо деяких твердокрилих комах.

5. Бавовна IPC 531, що випускається фірмою Monsanto Europe S.A., розташованою за адресою: 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium, реєстраційний номер C/ES/96/02.

6. Кукурудза 1507, що випускається фірмою Pioneer Overseas Corporation, розташованою за адресою: Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium, реєстраційний номер C/NL/00/10. Генетично модифікована кукурудза для експресування білка Cry IF для надання стійкості щодо деяких лускокрилих комах й експресування білка PAT для надання стійкості до гербіциду глүфосинат-амонію.

7. Кукурудза NK603×MON 810, що випускається фірмою Monsanto Europe S.A., розташованою за адресою: 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium, реєстраційний номер C/GB/02/M3/03. Включає гібридні сорти кукурудзи, одержані звичайною селекцією шляхом схрещування генетично модифікованих сортів NK603 та MON 810. Кукурудза NK603×MON 810 трансгенно експресує білок CP4 EPSPS, одержаний зі штаму *Agrobacterium* sp. CP4, що надає стійкості до гербіциду Roundup® (містить глүфосат), а також токсин CryI(A(b)), одержаний з *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, що надає стійкості до деяких лускокрилих, включаючи метелика кукурудзяного.

Трансгенні культури, стійкі щодо комах, також описані в публікації BATS (Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basel, Switzerland) Report 2003, (<http://bats.ch>).

Термін "корисні рослини" слід розуміти, як такий, що включає й корисні рослини, які шляхом використання методики на основі рекомбінантної ДНК змінені таким чином, що вони здатні синтезувати протипатогенні речовини, які здійснюють селективний вплив, такі як, наприклад, так називані "пов'язані з патогенезом білки" (PRP, [див., наприклад, EP-A-0392225]). Приклади таких протипатогенних речовин і трансгенних рослин, здатних синтезувати такі протипатогенні речовини, наведені, наприклад, в [EP-A-0392225, WO 95/33818, і EP-A-0353191]. Методики одержання таких трансгенних рослин звичайно відомі спеціалісту в даній галузі техніки та описані, наприклад, у зазначені вище публікаціях.

Протипатогенні речовини, які можуть експресуватися такими трансгенними рослинами, включають, наприклад, блокатори іонних каналів, такі як блокатори натрієвих і кальцієвих каналів, наприклад, вірусні токсини KPI, KP4 та KP6; стильбенсинтази; бібензилсинтази; хітинази; глюканазі; так називані "пов'язані з патогенезом білки" (PRPs, [див., наприклад, EP-A-0392225]); протипатогенні речовини, які продукуються мікроорганізмами, наприклад, пептидні антибіотики або гетероциклічні антибіотики [див., наприклад, WO 95/33818] або білкові або поліпептидні фактори, що приймають участь у захисті рослин від патогенів (так називані "гени резистентності рослин щодо хвороб", описані в [WO 03/000906]).

Корисними рослинами, які становлять підвищений інтерес у даному винаході є злаки, такі як

пшениця, жито, ячмінь і овес; кукурудза; дерен; овочі, такі як томати, гарбузи, боби та салат-латук; картопля; тютюн; цукровий буряк; рис; дерен; бавовна; соя; олійний рапс; бобові культури; соняшник; та декоративні рослини в садівництві. Із цих корисних рослин, які являють підвищений інтерес, можна особливо відзначити злаки.

Термін "матеріал для розмноження рослин" слід розуміти, як такий, що означає всі генеративні частини рослини, такі як насіння, яке можна застосовувати для розмноження останніх, і вегетативний матеріал, такий як черешки та бульби, наприклад, картопля. Наприклад, можна відзначити насіння (у точному значенні слова), корінь, плоди, бульби, цибулини, кореневища, частини рослин. Також можна відзначити пророслі рослини або розсаду, які необхідно пересадити після проростання або появи сходів із ґрунту. Цю розсаду можна захистити до пересадження шляхом повної або часткової обробки, проведеної шляхом занурення.

Кращий "матеріал для розмноження рослин" означає насіння.

Спосіб, пропонується у даному винаході, є особливо ефективним для боротьби з інфекціями, які розповсюджуються насінням та передаються через ґрунт або із ґрунтом, такими як *Alternaria* spp., *Ascochyta* spp., *Botrytis cinerea*, *Cercospora* spp., *Claviceps purpurea*, *Cochliobolus sativus*, *Colletotrichum* spp., *Epicoccit* spp., *Fusarium graminearum*, *Fusarium moniliforme*, *Fusarium oxysporum*, *Fusarium proliferatum*, *Fusarium solani*, *Fusarium subglutinans*, *Gaumannomyces graminis*, *Helminthosporium* spp., *Microdochium nivale*, *Penicillium* spp., *Phoma* spp., *Pyrenophora graminea*, *Pyricularia oryzae*, *Rhizoctonia solani*, *Rhizoctonia cerealis*, *Sclerotinia* spp., *Septoria* spp., *Sphacelotheca reiliana*, *Tilletia* spp., *Typhula incarnata*, *Urocystis occulta*, *Ustilago* spp. та *Verticillium* spp.; зокрема, для боротьби з патогенами злаків, таких як пшениця, ячмінь, жито та овес; кукурудзи; рису; бавовни; сої; дерну; цукрового буряка; олійного рапсу; картоплі; бобових культур, таких як горох, сочевиця та нут; і соняшника.

Сполуки формули I або композиції, що включають сполуки формули I, пропонується в даному винаході, є особливо корисними для боротьби з наступними хворобами рослин:

видами *Ascochyta* бобових культур,
Botrytis cinerea (сіра цвіль) соняшника,
Cochliobolus sativus злаків,
видами *Colletotrichum* бобових культур,
Fusarium graminearum злаків і кукурудзи,
Gaumannomyces graminis злаків і дерну,
Helminthosporium maydis кукурудзи,
Helminthosporium oryzae рису,
Helminthosporium solani картоплі,
Microdochium nivale пшениці та жита,
Pyrenophora graminea ячменю,
Pyricularia oryzae рису,
видами *Rhizoctonia* бавовни, сої, злаків, кукурудзи, картоплі, рису та дерну,
Sclerotinia homeocarpa дерну,
Sphacelotheca reiliana кукурудзи,
видами *Tilletia* злаків,

Typhula incarnata ячменю,
Urocystis occulta жита,
видами *Ustilago* злаків і кукурудзи.

Сполуки формули I наносять шляхом обробки матеріалу для розмноження рослин фунгіцидною ефективною кількістю сполуки формули I. Сполуки формули I краще наносити із забезпеченням прилипання сполук формули I до матеріалу для розмноження рослин у фунгіцидно ефективній кількості.

Кращим способом застосування є обробка насіння.

Хоч передбачається, що спосіб, пропонується у даному винаході, можна застосовувати до насіння, що знаходиться у будь-якому фізіологічному стані, краще, щоб насіння перебувало в досить довговічному стані, і воно не піддавалося ушкодженню під час обробки. Звичайно насіння являє собою насіння, зібране в полі, зняте з рослин та відділене від качана, стебла, зовнішньої лузги та оточуючої м'якоті і іншого рослинного матеріалу, що не є насінням. Краще, щоб насіння також було біологічно стабільним в такому ступені, щоб обробка не приводила до якого-небудь біологічного ушкодження насіння. Передбачається, що обробку насіння можна виконати в будь-який момент часу між збиранням насіння і висіванням насіння або під час висівання (спеціалізована обробка насіння).

"Проводять обробку невисіяного насіння" і термін "невисіяне насіння" включає насіння, використовуване в будь-який момент часу між збиранням насіння і висіванням насіння у ґрунт для пророщення та вирощування рослин.

Обробка невисіяного насіння не означає включення таких методик, при яких пестицид наносять на ґрунт, але включає будь-яку методику нанесення, при якій на насіння здійснюється вплив під час висівання.

Обробку краще проводити до висівання насіння, так щоб висіяне насіння було попередньо оброблене.

Сполуки формули I можна наносити до або після зараження матеріалу для розмноження рослин грибами.

Сполуки формули I звичайно наносять на матеріал для розмноження рослин спільно з допоміжними речовинами, звичайними в технології приготування композицій. Сполуки формули I переважно наносять на матеріал для розмноження рослин у вигляді композицій, але їх також можна наносити на матеріал для розмноження рослин одночасно або послідовно з додатковими сполуками. Цими "додатковими сполуками", наприклад, можуть бути добрива або джерела живильних мікроелементів, інші препарати, які впливають на ріст рослин, регулятори росту рослин, гербіциди, інсектициди, фунгіциди, бактерициди, регулятори росту комах, нематодциди, молюскоциди або суміші декількох таких препаратів, такі як два фунгіциди або фунгіцид і інсектицид, за потреби спільно з допоміжними речовинами, такими як носії, поверхнево-активні речовини або допоміжні речовини, які поліпшують нанесення, які звичайно використовуються при приготуванні композицій у даній галузі.

У кращому варіанті здійснення даний винахід стосується способу боротьби з фітопатогенними хворобами корисних рослин або матеріалу для розмноження цих рослин, який включає нанесення на зазначений матеріал для розмноження рослин фунгіцидно ефективної кількості композиції для захисту матеріалу для розмноження рослин, яка включає сполуку формули I разом з придатним для неї носієм.

Кращим способом застосування є обробка насіння.

Методики обробки насіння добре відомі спеціалістам у даній галузі техніки, і можуть легко застосовуватися в контексті даного винаходу. Сполуки формули I або композиції для захисту матеріалу для розмноження рослин, які включають сполуку формули I разом з придатним для неї носієм можна приготувати та нанести у вигляді зависі, твердого покриття для насіння, намочуванням або у вигляді дусту на поверхню насіння. Також можна відзначити, наприклад, нанесення плівкового покриття та капсулювання. Методики нанесення покриттів добре відомі в даній галузі техніки і для насіння використовуються методики нанесення плівкового покриття та капсулювання, а для інших продуктів для розмноження - методики занурення. Слід зазначити, що методика нанесення сполук формули I або композиції, що включає сполуки формули I разом з придатним для неї носієм, на насіння може змінюватися й даний винахід включає будь-яку необхідну методику.

Краща методика нанесення сполук формули I або композицій для захисту матеріалу для розмноження рослин, що включають сполуки формули I разом з придатним для неї носієм полягає в обприскуванні або змочуванні матеріалу для розмноження рослин рідким препаратом, у змішуванні рослинного матеріалу із твердим препаратом сполук формули I або композицією для захисту матеріалу для розмноження рослин, що включає сполуки формули I разом з придатним для неї носієм.

Сполуки формули I або композиції для захисту матеріалу для розмноження рослин, які включають сполуки формули I разом з придатним для неї носієм можна приготувати або змішати в баку апарата для обробки насіння або скомбінувати на насінні з іншими агентами для обробки насіння шляхом нанесення зовнішнього покриття. Агенти, що змішують зі сполуками формули I або композиціями для захисту матеріалу для розмноження рослин, які включають сполуки формули I разом з придатним для неї носієм можуть призначатися для боротьби зі шкідниками, модифікації росту, живлення або для боротьби із хворобами рослин.

Композиції для захисту матеріалу для розмноження рослин, які наносяться на матеріал для розмноження рослин, пропонувані в даному винаході, можна застосовувати у будь-якій звичайній формі, наприклад, у формі здвоєної упаковки, порошку для сухої обробки насіння (ПН), емульсії для обробки насіння (ЕН), текучого концентрату для обробки насіння (ТН), розчину для обробки насіння (РН), порошку, що диспергується у воді, для обробки насіння (ВН), капсульованої суспензії для обробки насіння (СН), гелю для обробки на-

сіння (ГН), концентрату емульсії (КЕ), концентрату суспензії (КС), суспоемульсії (СЕ), капсульованої суспензії (КС), гранул, що диспергуються у воді, (ВГ), гранул, що емульгуються, (ЕГ), емульсії типу воді-у-маслі (ЕМ), емульсії типу масло-у-воді (ЕВ), мікроемульсії (МЕ), масляної дисперсії (МД), сипкої речовини, що змішується з маслом, (МС), рідини, що змішується з маслом, (МР), розчинного концентрату (РК), суспензії для ультрамалооб'ємного обприскування (СУ), рідини для ультрамалооб'ємного обприскування (РУ), технічного концентрату (ТК), концентрату, що диспергується, (ДК), порошку, що змочується (ЗП) або будь-якої технічно можливої композиції в комбінації з сільськогосподарсько прийнятними допоміжними речовинами.

Такі композиції для захисту матеріалу для розмноження рослин можна приготувати звичайним чином, наприклад, шляхом змішування активних інгредієнтів з придатними інертними речовинами, що застосовуються в препаратах (розріджувачами, розчинниками, наповнювачами та необов'язково іншими інгредієнтами, що застосовуються в препаратах, такими як поверхнево-активні речовини, біоциди, антифризи, сполучні, загусники та сполуки, які надають додаткових властивостей). Якщо потрібен тривалий вплив, то можна застосовувати звичайні препарати вповільненого вивільнення. Зокрема, препарати, які наносять шляхом обприскування, такі як концентрати, що диспергуються у воді, (наприклад, КЕ, КС, ДК, МД, СЕ, ЕВ, ЕМ і т.п.), порошки, що змочуються, та гранули, можуть містити поверхнево-активні речовини, такі як змочувальні й диспергуючі агенти й інші сполуки, які надають додаткових властивостей, наприклад, продукт конденсації формальдегіду з нафталінсульфонатом, алкіларилсульфонат, лігнінсульфонат, алкілсульфат жирної кислоти й етоксирований алкілфенол, і етоксирований жирний спирт.

Такі композиції для захисту матеріалу для розмноження рослин можуть включати один або більшу кількість інших пестицидів, наприклад, фунгіцид, акарицид, бактерицид, інсектицид, моллюскоцид, нематодцид, родентицид, два фунгіциди або фунгіцид і інсектицид.

Термін "носій" у даному винаході означає природну або синтетичну, органічну або неорганічну речовину, з якою поєднують сполуку формули I для полегшення її нанесення на рослину, на насіння або на ґрунт. Тому такий носій звичайно є інертним і повинен бути сільськогосподарсько прийнятним, зокрема, придатним для оброблюваної рослини. Носій може бути твердим (глини, природні або синтетичні силікати, діоксид кремнію, смоли, віск, тверді добрива й т.п.) або рідким (вода, спирти, кетони, нафтові фракції, ароматичні або парафінові вуглеводні, хлоровані вуглеводні, зріджені гази й т.п.).

Твердими носіями, які можна використовувати, наприклад, для дуетів і порошоків, що диспергуються, є кальцит, тальк, каолін, монтморилоніт або атапульгіт, високодисперсний діоксид кремнію або вбираючі полімери. Можливими подрібненими вбираючими носіями для гранул є пемза, подрібнена цегла, сепіоліт або бентоніт, глина типу мон-

тморилоліну, і можливими невбираючими носіями є кальцит або доломіт.

Придатними рідкими носіями є: ароматичні вуглеводні, краще - фракції C₈-C₁₂ алкілбензолів, такі як суміші ксилолів або заміщені нафталіни, ефіри фталевої кислоти, такі як дибутил- або діоктилфталат, аліфатичні вуглеводні, такі як циклогексан або парафіни, спирти та гліколи, а також їх прості та складні ефіри, такі як монометилловий ефір етиленгліколю, кетони, такі як циклогексанон, сильно полярні розчинники, такі як N-метил-2-піролідон, диметилсульфоксид або диметилформамід, і, якщо це є придатним, епоксидовані рослинні олії або соєва олія; або вода.

Придатними поверхнево-активними речовинами є, залежно від типу активного інгредієнта, внесеного в композицію (тільки сполуки формули I або сполуки формули I у комбінації з іншими активними інгредієнтами), неіоногенні, катіоногенні і/або аніоногенні поверхнево-активні речовини, які мають гарну емульгуювальну, диспергуючу та змочувальну здатність. Під поверхнево-активними речовинами також слід розуміти й суміші поверхнево-активних речовин.

Поверхнево-активні речовини, які звичайно застосовуються в технології приготування композицій, зокрема, описані в наступних публікаціях:

["McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publishing Corp., Glen Rock, N.J., 1988.

M. and J. Ash, "Encyclopedia of Surfactants", Vol. I-III, Chemical Publishing Co., New York, 1980-1981].

Із числа придатних поверхнево-активних речовин можна відзначити, наприклад, солі поліакрилової кислоти, солі лігносульфонової кислоти, солі фенолсульфонової або (моно- або діалкіл)нафталінсульфонової кислоти, солі лаурилсульфонової кислоти, продукти поліконденсації етиленоксиду із солями лігносульфонової кислоти, продукти поліконденсації етиленоксиду з жирними спиртами, або з жирними кислотами, або з жирними амінами, заміщені феноли (переважно, алкілфеноли або арилфеноли, такі як моно- або ди-(поліоксіалкіленалкілфенол)фосфати, поліоксіалкіленалкілфенолкарбоксилати або поліоксіалкіленалкілфенолсульфати), солі складних ефірів сульфобурштинової кислоти, похідні таурину (переважно - алкілтауриди), продукти поліконденсації етиленоксиду з фосфатованими тристирилфенолами та продукти поліконденсації етиленоксиду з ефірами фосфорної кислоти зі спиртами або фенолами. Присутність принаймні однієї поверхнево-активної речовини часто необхідна, оскільки активні інгредієнти і/або інертні розчинники часто нерозчинні у воді, а носієм для нанесення є вода.

Крім того, особливо придатними допоміжними речовинами, які поліпшують нанесення, є натуральні або синтетичні фосфоліпіди із групи цефалінів і лецитинів, наприклад, фосфатидилетаноламін, фосфатидилсерин, фосфатидилгліцерин або лізолецитин.

Композиції для захисту матеріалу для розмноження рослин також можуть включати один або більшу кількість полімерів, вибраних із числа

розчинних у воді та здатних диспергуватися у воді плівкоутворюючих полімерів, які поліпшують прилипання принаймні сполуки формули I до оброблюваного матеріалу для розмноження рослин, і цей полімер звичайно має середню молекулярну масу, що дорівнює від не менш ніж 10000 до приблизно 100000.

Звичайно в композицію для захисту матеріалу для розмноження рослин включають забарвлювальний агент, такий як барвник або пігмент, так щоб спостерігач відразу ж зміг встановити, що матеріал для розмноження рослин піддають обробці. Композиції для захисту матеріалу для розмноження рослин, які включають забарвлювальний агент, є кращими варіантами здійснення композицій для захисту матеріалу для розмноження рослин, пропонувані в даному винаході, оскільки вони підвищують безпеку для користувача та споживача. Забарвлювальний агент також застосовується для оцінки користувачем ступеня рівномірності нанесення композиції для захисту матеріалу для розмноження рослин.

Звичайно, забарвлювальний агент, має температуру плавлення, що перевищує 30°C, і тому його суспендують у композиції для захисту матеріалу для розмноження рослин, пропонуваної в даному винаході. Забарвлювальний агент також може бути розчинною сполукою.

Як приклади забарвлювальних агентів можна відзначити червоний пігмент 48-2 (CAS-7023-61-2), синій пігмент 15 (CAS-147-14-8), зелений пігмент 7 (CAS-1328-53-6), фіолетовий пігмент 23 (CAS-6358-30-1), червоний пігмент 53-1 (CAS-5160-02-1), червоний пігмент 57-1 (CAS 5281-04-9), червоний пігмент 112 (CAS 6535-46-2) і аналогічні забарвлювальні агенти.

Композиції для захисту матеріалу для розмноження рослин звичайно містять від 0,1 до 10мас.% забарвлювального агенту.

Хоч продукти, які випускаються у продаж, краще приготувати у вигляді концентратів (відомих, як премікс композиції (або концентрат, приготовлена сполука (або продукт)), кінцевий користувач звичайно використовує розведені препарати, що також необов'язково містять один або більшу кількість преміксів інших пестицидів (що відомі як бакова суміш композиції (або готова до застосування, бульйон для обприскування, або завись)) для обробки матеріалу для розмноження, але може використовувати й відповідним чином складені премікси композицій.

Баккові суміші композицій звичайно приготують шляхом розведення розчинником (наприклад, водою) одного або більшої кількості преміксів композицій, які містять різні пестициди та необов'язково інші допоміжні речовини. Звичайно кращою є водна бакова суміш.

Відповідно до цього приклади композицій для захисту матеріалу для розмноження рослин, пропонуваних у даному винаході, включають бакову суміш і завись пестицидних композицій і премікс або пестицидні препарати.

Звичайно препарати включають від 0,01 до 90мас.% активного агенту, від 0 до 20% сільськогосподарсько прийнятної поверхнево-активної ре-

човини та від 10 до 99,99% твердих або рідких носіїв і допоміжної речовини (речовин), активний агент містить принаймні сполуку формули I, і необов'язково інші активні агенти, переважно - мікробіоциди або консерванти й т.п.

Концентровані форми композицій (такі як премікс або пестицидні препарати) звичайно містять приблизно від 2 до 80%, переважно - приблизно від 5 до 70мас.% активного агента.

Баккові суміші та зависі концентрованих форм композицій (розведені препарати) можуть, наприклад, містити від 0,01 до 20мас.%, переважно - від 0,01 до 5мас.% активного агента.

Кількість сполуки формули I, яка застосовується для матеріалу для розмноження, змінюється залежно від типу матеріалу для розмноження (наприклад, насіння або бульби) і рослини (наприклад, у перерахунок на еквівалентну масу насіння на насіння пшениці звичайно наносять менш активні інгредієнти, ніж на насіння олійного рапсу), і фунгіцидно ефективну кількість можна визначити шляхом біологічних досліджень.

Якщо сполуки формули I або композиції для захисту матеріалу для розмноження рослин, що включають сполуки формули I разом з придатним для неї носієм, застосовують для обробки насіння, то звичайно є достатніми норми витрати, що дорівнюють від 0,1 до 5000г сполуки формули I на 100кг насіння, краще - від 1 до 1000г на 100кг насіння, найкраще - від 1 до 100г на 100кг насіння.

Іншим об'єктом даного винаходу є композиція для захисту матеріалу для розмноження рослин, яка включає сполуку формули I разом з придатним для неї носієм.

Кращим варіантом здійснення цього об'єкта даного винаходу є композиція для захисту матеріалу для розмноження рослин, яка включає сполуку формули I разом з придатним для неї носієм, причому зазначена композиція для захисту матеріалу для розмноження рослин додатково включає забарвлювальний агент.

Ще одним об'єктом даного винаходу є матеріал для розмноження рослин, оброблений композицією для захисту матеріалу для розмноження рослин, що включає сполуку формули I разом з придатним для неї носієм.

Кращим варіантом здійснення цього об'єкта даного винаходу є матеріал для розмноження рослин, оброблений композицією для захисту матеріалу для розмноження рослин, що включає сполуку формули I разом з придатним для неї носієм, причому зазначена композиція для захисту матеріалу для розмноження рослин додатково включає забарвлювальний агент.

Наведені нижче приклади призначені для ілюстрації даного винаходу, "активний інгредієнт" означає сполуку формули I.

Приклади препаратів

Порошки, що змочуються	a)	b)	c)
активний інгредієнт	25%	50%	75%
лігносульфонат натрію	5%	5%	-
лаурилсульфат натрію	3%	-	5%
діізобутилнафталінсульфонат натрію	-	6%	10%
фенолполіетиленгліколевий ефір (7-8моль етиленоксиду)	-	2%	-

вискодиспергована кремнієва кислота	5%	10%	10%
каолін	62%	27%	-

Активний інгредієнт ретельно змішують із допоміжними речовинами й суміш ретельно розмелюють на придатному млині та одержують порошки, що змочуються, які можна розбавити водою та одержати суспензії необхідної концентрації.

Порошки для сухої обробки насіння	a)	b)	c)
активний інгредієнт	25%	50%	75%
легке мінеральне масло	5%	5%	5%
вискодиспергована кремнієва кислота	5%	5%	-
каолін	65%-	40%	-
тальк	-	-	20

Активний інгредієнт ретельно змішують із допоміжними речовинами й суміш ретельно розмелюють на придатному млині та одержують порошки, які можна безпосередньо використовувати для обробки насіння.

Концентрат, що емульгується	
активний інгредієнт	10%
октилфенолполіетиленгліколевий ефір (4-5моль етиленоксиду)	3%
додецилбензолсульфонат кальцію полігліколевий ефір рицинової олії (35моль етиленоксиду)	3%
циклогексанон	4%
суміш ксилолів	30%
октилфенолполіетиленгліколевий ефір (4-5моль етиленоксиду)	50%

Із цього концентрату шляхом розведення водою можна одержати емульсії будь-якого необхідного розведення, які можна використовувати для захисту рослин.

Дуети	a)	b)	c)
активний інгредієнт	5%	6%	4%
тальк	95%	-	-
каолін	-	94%	-
мінеральний наповнювач	-	-	96%

Готові до застосування дуети одержують шляхом змішування активного інгредієнта з носієм і розмелу суміші на придатному млині. Такі порошки також можна використовувати для сухого протруювання насіння.

Екструдовані гранули	
активний інгредієнт	15%
лігносульфонат натрію	2%
карбоксиметилцелюлоза	1%
каолін	82%

Активний інгредієнт змішують і розмелюють із допоміжними речовинами та суміш зволожують водою. Суміш екструдує і потім сушать у потоці повітря.

Гранули з покриттям	
активний інгредієнт	8%
поліетиленгліколь (молекулярна маса 200)	3%
каолін	89%

Тонкоподрібнений активний інгредієнт у змішувачі рівномірно наносять на каолін, зволожений поліетиленгліколем. У такий спосіб одержують гранули з покриттям, що не утворюють пил.

Концентрат суспензії

активний інгредієнт	40%
пропіленгліколь	10%
нонілфенолполіетиленгліколевий ефір	
(15моль 6% етиленоксиду)	6%
лігносульфонат натрію	10%
карбоксиметилцелюлоза	1%
силіконове масло (у вигляді 75% емульсії у воді)	1%
вода	32%

Тонкоподрібнений активний інгредієнт ретельно змішують із допоміжними речовинами та одержують концентрат суспензії, з якого шляхом розведення водою можна одержати суспензії будь-якого необхідного розведення. За допомогою таких розведених систем живі рослини, а також матеріал для розмноження рослин можна обробити та захистити від зараження мікроорганізмами шляхом обприскування, поливу або занурення.

Текучий концентрат для обробки насіння	
активний інгредієнт	40%
пропіленгліколь	5%
співполімер бутанол ПО/ЕО*	2%
тристирилфенол з 10-20моль ЕО	2%
1,2-бензизотіазолін-3-он (у вигляді 20% водного розчину)	0,5%
кальцієва сіль моноазопігменту	5%
силіконове масло (у вигляді 75% емульсії у воді)	0,2%
вода	45,3%

*ПО - пропіленоксид, ЕО - етиленоксид.

Тонкоподрібнений активний інгредієнт ретельно змішують із допоміжними речовинами та одержують концентрат суспензії, з якого шляхом розведення водою можна одержати суспензії будь-якого необхідного розведення. За допомогою таких розведених систем живі рослини, а також матеріал для розмноження рослин можна обробити та захистити від зараження мікроорганізмами шляхом обприскування, поливу або занурення.

Біологічні приклади

Приклад В-1: Активність щодо *Gaumannomyces graminis* на пшениці

Після нанесення активного інгредієнта, приготовленого у вигляді текучого концентрату для обробки насіння, на насіння озимої пшениці, насіння висівають у лотки, заповнені польовим ґрунтом. Перед висіванням польовий ґрунт штучно інюкують за допомогою *Gaumannomyces graminis* шляхом ретельного перемішування міцелію із ґрунтом. Рослини витримують у теплиці протягом 5 тижнів при 17°C і 14-годинному світловому періоді. Визначають виражене у % побуріння коренів. Кожне значення визначають для 30 насінин при кожній обробці (3 рази по 10 насінин).

Кількість, у г, рацемічної сполуки формули Ia/100кг насіння	Побуріння коренів, %	Контроль
----	50	0
33	20	60
10	28	44

Приклад В-2: Активність щодо *Microdochium nivale* на пшениці Після нанесення активного інгредієнта, приготовленого у вигляді текучого концентрату для обробки насіння, на заражене за допомогою *M nivale* насіння озимої пшениці, насіння висівають у лотки, заповнені садовим ґрунтом. Рослини витримують у теплиці протягом 4 тижнів

при 4°C у темряві. Потім температуру підвищують до 15°C і підтримують 12-годинний світловий період. Після утворення первинних листків рослини витримують при 10°C і високій вологості до закінчення експерименту. Визначають кількість заражених рослин. Кожне значення визначають для 100 насінин при кожній обробці (2 рази по 50 насінин).

Кількість, у г, рацемічної сполуки формули Ia/100кг насіння	Заражених рослин, %	Контроль
----	38	0
10	5	86,8

Приклад В-3: Активність щодо *Puccinia graminea* на ячмені Після нанесення активного інгредієнта, приготовленого у вигляді текучого концентрату для обробки насіння, на заражене за допомогою *P. graminea* насіння озимого ячменю, насіння висівають у лотки, заповнені польовим ґрунтом. Лотки витримують в оранжереї протягом 3 тижнів при 4°C. Після цього досліджувані рослини переносять у теплицю, у якій підтримують температуру на рівні 12°C, і 14-годинний світловий період. Визначають кількість заражених рослин. Кожне значення визначають для 200 насінин при кожній обробці (2 рази по 100 насінин).

Кількість, у г, рацемічної сполуки формули Ia/100кг насіння	Заражених рослин, %	Контроль
----	54	0
10	1	98,1

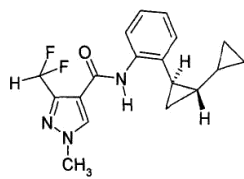
Приклад В-4: Активність щодо *Ustilago nuda* на ячмені

Після нанесення активного інгредієнта, приготовленого у вигляді текучого концентрату для обробки насіння, на заражене за допомогою *U. nuda* насіння озимого ячменю, насіння висівають у лотки, заповнені польовим ґрунтом. Лотки переносять в оранжерею та витримують протягом 2 днів при 20°C і потім протягом 2 тижнів при 2°C. Після цього досліджувані рослини переносять у теплицю, у якій до цвітіння підтримують температуру на рівні 15°C, і 14-годинний світловий період. Визначають кількість заражених колосків. Кожне значення визначають для 200 насінин при кожній обробці (2 рази по 100 насінин).

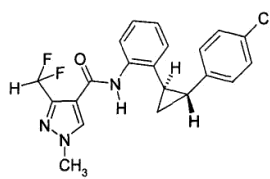
Кількість, у г, рацемічної сполуки формули Ia/100кг насіння	Заражених рослин, %	Контроль
----	23,1	0
5	0	100
2,5	0	100

Приклад В-5: Порівняльне дослідження зі сполукою попереднього рівня техніки: Активність щодо *Ustilago nuda* на ячмені

Активність щодо *Ustilago nuda* на ячмені рацемічної сполуки формули Ia, пропонованої в даному винаході, порівнювали з активністю рацемічної сполуки В, що описана, як [сполука №2.69 на стор.7, таблиця 2, і стор.16, таблиця 7, у WO 03/074491]. Методика, використана для порівняння активності, описана вище в прикладі В-4.



(сполука формули 1a, пропонована в даному винаході)



(сполука B попереднього рівня техніки)

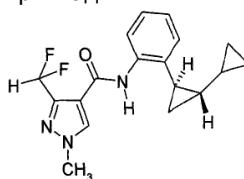
	Кількість, у г, активного інгредієнта на 100кг насіння	Заражених рослин, %	Контроль %
-	-	13	0
Рацемічна сполука формули 1a	10	0	100
Рацемічна сполука B	10	11,9	9

Отримані результати показують, що при нормі витрати, що дорівнює 10г активного інгредієнта на 100кг насіння, рацемічна сполука формули 1a, пропонована в даному винаході проявляє значно більш сильний фунгіцидний вплив на *Ustilago nuda* на ячмені, ніж рацемічна сполука B попереднього рівня техніки. Через структурну подібність сполук посилений вплив сполук, пропонованих у даному винаході, не був очікуваним.

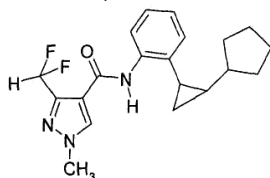
Приклад B-6: Порівняльне дослідження зі сполукою попереднього рівня техніки: Активність щодо *Ustilago nuda* на ячмені

Активність щодо *Ustilago nuda* на ячмені рацемічної сполуки формули 1a, пропонованої у даному винаході, порівнювали з активністю рацемічної сполуки C (співвідношення транс/цис-ізомерів: 10:1), що описана, як [сполука №2.40 на стор.6 та 7, таблиця 2, у WO 03/074491]. Методика, викори-

стана для порівняння активності, описана вище у прикладі B-4.



(сполука формули 1a, пропонована в даному винаході)



(сполука C попереднього рівня техніки)

	Кількість, у г, активного інгредієнта на 100кг насіння	Заражених колосків, %	Контроль %
-	-	13	0
Рацемічна сполука формули 1a	10	0	100
Рацемічна сполука C	10	11,6	11

Отримані результати показують, що при нормі витрати, що дорівнює 10г активного інгредієнта на 100кг насіння, рацемічна сполука формули 1a, пропонована в даному винаході проявляє значно більш сильний фунгіцидний вплив на *Ustilago nuda*

на ячмені, ніж рацемічна сполука C попереднього рівня техніки. Через структурну подібність сполук посилений вплив сполук, пропонованих у даному винаході, не був очікуваним.