

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(11) **044292**

(13) **B1**

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ

- | | |
|---|---|
| (45) Дата публикации и выдачи патента
2023.08.14 | (51) Int. Cl. <i>A01N 43/653</i> (2006.01)
<i>A01N 37/50</i> (2006.01)
<i>A01N 43/40</i> (2006.01)
<i>A01N 43/42</i> (2006.01)
<i>A01N 43/52</i> (2006.01)
<i>A01N 43/56</i> (2006.01)
<i>A01N 43/713</i> (2006.01)
<i>A01N 43/84</i> (2006.01)
<i>A01N 43/90</i> (2006.01)
<i>A01N 47/24</i> (2006.01)
<i>A01P 3/00</i> (2006.01) |
| (21) Номер заявки
202191562 | |
| (22) Дата подачи заявки
2019.12.02 | |

(54) СПОСОБ БОРЬБЫ С SCLEROTINIA SPR. В МАСЛИЧНОМ РАПСЕ ИЛИ КАНОЛЕ КОМПОЗИЦИЯМИ, СОДЕРЖАЩИМИ МЕФЕНТРИФЛУКОНАЗОЛ

- | | |
|---|------------------------------|
| (31) 18211681.4 | (56) WO-A1-2018105663 |
| (32) 2018.12.11 | CN-A-108541711 |
| (33) EP | WO-A2-2018077711 |
| (43) 2021.10.18 | WO-A1-2014095994 |
| (86) PCT/EP2019/083329 | |
| (87) WO 2020/120202 2020.06.18 | |
| (71)(73) Заявитель и патентовладелец:
БАСФ АГРО Б.В. (NL) | |
| (72) Изобретатель:
Кокийе Микаэль (ZA), Гевер Маркус (DE) | |
| (74) Представитель:
Веселицкий М.Б., Кузенкова Н.В.,
Каксис Р.А., Белоусов Ю.В., Куликов
А.В., Кузнецова Е.В., Соколов Р.А.,
Кузнецова Т.В. (RU) | |

-
- (57)** Изобретение относится к способу борьбы с фитопатогенными грибами, выбранными из *Sclerotinia spp.*, в особенности *Sclerotinia sclerotiorum*, на масличном рапсе, включающему в себя обработку растений, их семян или почвы фунгицидно эффективным количеством композиции, содержащей мефентрифлуконазол и соединение (II), представляющее собой боскалид или его приемлемые в сельском хозяйстве соли.

B1

044292

044292

B1

Изобретение относится к способу борьбы с *Sclerotinia* spp. в масличном рапсе или каноле, включающему обработку растений, их семян или почвы фунгицидно эффективным количеством композиции, содержащей:

I) мефентрифлуконазол или его приемлемые в сельском хозяйстве соли в виде соединения (I);

II) боскалид или его приемлемые в сельском хозяйстве соли в виде соединения (II).

Мефентрифлуконазол (I), его получение и применение в защите сельскохозяйственных культур описаны в заявке WO 2013/007767, в которой также описаны определенные композиции с другими активными соединениями. Благодаря основному характеру его атомов азота мефентрифлуконазол способен образовывать соли или аддукты с неорганическими или органическими кислотами или с ионами металлов, в частности, соли с неорганическими кислотами. Смеси мефентрифлуконазола описаны в WO 2014/095994.

Мефентрифлуконазол (I) содержит хиральные центры и его обычно получают в виде рацематов. R- и S-энантиомеры мефентрифлуконазола (I) могут быть разделены и выделены в чистом виде способами, известными специалисту в данной области, например с помощью хиральной ВЭЖХ.

Следовательно, в способе в соответствии с настоящим изобретением мефентрифлуконазол (I) может быть использован в виде:

рацемической смеси (R)-энантиомера и (S)-энантиомера; смеси с любыми другими пропорциями (R)-энантиомера и (S)-энантиомера;

чистого (R)-энантиомера или чистого (S)-энантиомера.

Мефентрифлуконазол (I) может быть предоставлен и использован в виде (R)-энантиомера с энантиомерным избытком (э. и.) по меньшей мере 40%, например, по меньшей мере 50, 60, 70 или 80, предпочтительно по меньшей мере 90, более предпочтительно по меньшей мере 95, еще более предпочтительно по меньшей мере 98 и наиболее предпочтительно по меньшей мере 99%. Это относится к каждой композиции, описанной в настоящем изобретении. (R)-энантиомер мефентрифлуконазола имеет химическое название:

(R)-2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол;

Кроме того, мефентрифлуконазол (I) может быть предоставлен и использован в виде (S)-энантиомера с энантиомерным избытком (э.и.) по меньшей мере 40%, например, по меньшей мере 50, 60, 70 или 80, предпочтительно по меньшей мере 90, более предпочтительно по меньшей мере 95, еще более предпочтительно по меньшей мере 98 и наиболее предпочтительно по меньшей мере 99%. Это относится к каждой композиции, описанной в настоящем изобретении. (S)-энантиомер мефентрифлуконазола имеет химическое название:

(S)-2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол.

Соединения (II), а также его пестицидное действие и способы его получения являются общеизвестными (см.: <http://www.alanwood.net/pesticides/>); эти вещества коммерчески доступны.

К приемлемым в сельском хозяйстве солям, в частности, относят соли тех катионов или кислотных аддитивных солей тех кислот, катионы, соответственно анионы, которых не оказывают неблагоприятного эффекта на фунгицидную активность указанных соединений. Таким образом, пригодными катионами являются, в частности, ионы щелочных металлов, предпочтительно натрия и калия, щелочноземельных металлов, предпочтительно кальция, магния и бария, переходных металлов, предпочтительно марганца, меди, цинка и железа, а также ион аммония, который, при желании, может нести от одного до четырех C₁-C₄-алкильных заместителя и/или один фенильный или бензильный заместитель, предпочтительно диизопропиламмония, тетраметиламмония, тетрабутиламмония, триметилбензиламмония, кроме того, ионы фосфония, ионы сульфония, предпочтительно три(C₁-C₄-алкил)сульфония и ионы сульфоксония, предпочтительно три(C₁-C₄-алкил)сульфоксония. Анионами пригодных кислотных аддитивных солей в первую очередь являются хлорид, бромид, фторид, гидросульфат, сульфат, дигидрофосфат, гидрофосфат, фосфат, нитрат, бикарбонат, карбонат, гексафторсиликат, гексафторфосфат, бензоат, а также анионы C₁-C₄-алкановых кислот, предпочтительно формиат, ацетат, пропионат и бутират. Они могут быть образованы взаимодействием такого соединения в соответствии с изобретением с кислотой соответствующего аниона, предпочтительно соляной кислотой, бромистоводородной кислотой, серной кислотой, фосфорной кислотой или азотной кислотой.

Sclerotinia spp., в особенности *Sclerotinia sclerotiorum*, вызывают склеротиниоз - гниль стебля (SSR), основное заболевание масличного рапса или канолы. Во время заражения на стеблях растения-хозяина образуются большие белые/серые поражения, нарушающие развитие семян и снижающие урожайность. *Sclerotinia* spp., в особенности *Sclerotinia sclerotiorum*, могут создавать структуры для длительного хранения и сохраняться в почве в течение длительного времени. Для фермеров борьба с *Sclerotinia* spp. становится все труднее и труднее. Для снижения потерь урожая и получения оптимальной урожайности культур требуется надлежащая борьба с вредителями.

Неожиданно авторами изобретения было обнаружено, что применение композиций, содержащих мефентрифлуконазол и соединение (II), определенное в настоящем изобретении, демонстрирует неожиданное фунгицидное действие в отношении *Sclerotinia* spp., в особенности в отношении *Sclerotinia sclerotiorum*.

Таким образом, настоящее изобретение относится к способу борьбы с фитопатогенными грибами, выбранными из *Sclerotinia* spp., на масличном рапсе или каноле, включающему в себя обработку растений, их семян или почвы фунгицидно эффективным количеством композиции, содержащей:

I) мефентрифлуконазол или его приемлемые в сельском хозяйстве соли в виде соединения (I);

II) боскалид или его приемлемые в сельском хозяйстве соли в виде соединения (II).

Кроме этого изобретение относится к применению композиций, содержащих мефентрифлуконазол (I) и соединение (II), как описано в настоящем изобретении для борьбы с фитопатогенными грибами, выбранными из *Sclerotinia* spp., в особенности *Sclerotinia sclerotiorum*, на масличном рапсе или каноле.

Настоящее изобретение относится к способу борьбы с *Sclerotinia* spp. В конкретном варианте осуществления настоящее изобретение относится к способу борьбы с *Sclerotinia sclerotiorum*.

В соответствии с изобретением соединение (II) представляет собой боскалид (II).

В соответствии с конкретным вариантом осуществления композиция содержит мефентрифлуконазол (I) и соединение (II) в качестве единственных активных веществ композиции.

Массовое соотношение соединения I и соединения II, как правило, составляет от 500:1 до 1:500, предпочтительно от 100:1 до 1:100, более предпочтительно от 50:1 до 1:50, еще более предпочтительно от 20:1 до 1:20, наиболее предпочтительно от 10:1 до 1:10. Соотношения также могут составлять от 1:5 до 5:1, или 1:1.

Соединение (I) и соединение (II) можно применять одновременно, то есть совместно или по отдельности, или последовательно. В соответствии с одним вариантом осуществления соединение (I) и соединение (II) применяют одновременно. Согласно другому варианту осуществления соединение (I) и соединение (II) применяют последовательно.

В одном варианте осуществления способ включает в себя обработку масличного рапса или растительной канолы.

В другом варианте осуществления способ включает в себя обработку семян масличного рапса или канолы.

В другом варианте осуществления способ включает обработку почвы.

В предпочтительном варианте осуществления настоящее изобретение относится к способу борьбы с *Sclerotinia sclerotiorum* на масличном рапсе или каноле, включающему в себя обработку растений, их семян или почвы фунгицидно эффективным количеством композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II), как описано в настоящем изобретении. В конкретном варианте осуществления способ включает в себя обработку растений масличного рапса или канолы. В другом конкретном варианте осуществления способ включает обработку семян масличного рапса или канолы.

Обработка растений, их семян или почвы в способе в соответствии с настоящим изобретением может быть осуществлена путем распыления, обработки семян, капельного внесения и полива, внесения в борозду, нанесения на семена и общего заделывания почвы, химигации, т.е. путем добавления активных веществ в воду для полива и в гидропонных/минеральных системах.

Конкретные варианты осуществления настоящего изобретения приведены в таблице.

Каждая строка строк А-1 - А-12 соответствует одному конкретному варианту осуществления изобретения.

Способы борьбы с *Sclerotinia* spp.

№ способа	Композиция	Патоген	Культура	Применение
А-1.	(I) + (II)	<i>Sclerotinia</i> spp.	Масличный рапс	растение
А-2.	(I) + (II)	<i>Sclerotinia</i> spp.	Масличный рапс	семена
А-3.	(I) + (II)	<i>Sclerotinia</i> spp.	Масличный рапс	почва
А-4.	(I) + (II)	<i>Sclerotinia sclerotiorum</i>	Масличный рапс	растение
А-5.	(I) + (II)	<i>Sclerotinia sclerotiorum</i>	Масличный рапс	семена
А-6.	(I) + (II)	<i>Sclerotinia sclerotiorum</i>	Масличный рапс	почва
А-7	(I) + (II)	<i>Sclerotinia</i> spp.	Канола	растение
А-8	(I) + (II)	<i>Sclerotinia</i> spp.	Канола	семена
А-9	(I) + (II)	<i>Sclerotinia</i> spp.	Канола	почва
А-10	(I) + (II)	<i>Sclerotinia sclerotiorum</i>	Канола	растение
А-11	(I) + (II)	<i>Sclerotinia sclerotiorum</i>	Канола	семена
А-12	(I) + (II)	<i>Sclerotinia sclerotiorum</i>	Канола	почва

Термин "материал для размножения растений" следует понимать как обозначающий все генеративные части растения, в частности семена.

Растения, а также материал для размножения указанных растений, которые можно обрабатывать фунгицидно эффективным количеством композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II), как описано в настоящем изобретении, включают все генетически модифицированные растения или трансгенные растения, например, сельскохозяйственные культуры, устойчивые к действию гербицидов

или фунгицидов или инсектицидов вследствие селекции, включая методы генной инженерии, или растения, которые имеют измененные характеристики по сравнению с существующими растениями, которые могут быть получены, например, с помощью традиционных методов селекции и/или создания мутантов, или рекомбинантными методами.

Например, смеси в соответствии с настоящим изобретением могут быть применены (для протравливания семян, обработка распылением, в борозде или другими способами) также на растениях, которые были изменены благодаря выращиванию, мутагенезу или генной инженерии включая, но, не ограничиваясь биотехнологические аграрные продукты, находящиеся на рынке или в разработке (см. http://www.bio.org/speeches/pubs/er/agri_products.asp). Генетически модифицированные растения представляют собой растения, генетический материал которых был изменен с использованием технологий рекомбинантной ДНК таким образом, который в природных условиях не может быть получен быстро путем скрещивания, мутаций или природной рекомбинации. Обычно, один или несколько генов были интегрированы в генетический материал генетически модифицированного растения для того, чтобы улучшить некоторые свойства растения. Подобные генетические изменения также включают, но не ограничиваются ними, целевые посттрансляционные модификации белка(ов), олигопептидов или полипептидов, например, с помощью гликозилирования или присоединений полимеров, таких как пренилированные, ацетилированные или фарнезилированные части или части ПЭГ.

Для применения в соответствии с настоящим изобретением композицию, содержащую мефентрифлуконазол (I) и соединение (II) как описано в настоящем изобретении, можно преобразовать в обычные составы, например растворы, эмульсии, суспензии, тонкие порошки, порошки, пасты и гранулы. Форма использования зависит от конкретной цели; в каждом случае должно быть обеспечено тонкое и равномерное распределение смесей согласно настоящему изобретению. Составы получают известным способом (см. US 3,060,084, EP-A 707 445 (для жидких концентратов), Browning: "Agglomeration", Chemical Engineering, Dec. 4, 1967, 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4-е изд., McGraw-Hill, New York, 1963, S. 8-57 и на доп. сс. WO 91/13546, US 4,172,714, US 4,144,050, US 3,920,442, US 5,180,587, US 5,232,701, US 5,208,030, GB 2,095,558, US 3,299,566, Klingman: Weed Control as a Science (J. Wiley & Sons, New York, 1961), Hance et al.: Weed Control Handbook (8-е изд., Blackwell Scientific, Oxford, 1989) и Mollet, H. and Grubemann, A.: Formulation technology (Wiley VCH Verlag, Weinheim, 2001).

Агрохимические составы могут также содержать вспомогательные вещества, которые обычно используют в агрохимических составах. Используемые вспомогательные вещества зависят от конкретной формы применения и активного вещества, соответственно.

Примерами пригодных вспомогательных веществ являются растворители, твердые носители, диспергаторы или эмульгаторы (такие как дополнительные солибулизаторы, защитные коллоиды, поверхностно-активные вещества и адгезионные агенты), органические и неорганические загустители, бактерициды, антифризы, пеногасители, при необходимости красители и вещества, повышающие клейкость или связующие вещества (например, для составов для обработки семян).

Пригодными растворителями являются вода, органические растворители, такие как фракции минеральных масел от средней до высокой точек кипения, такие как керосин и дизельное масло, далее каменноугольные масла, а также масла растительного или животного происхождения, алифатические, циклические и ароматические углеводороды, например, толуол, ксилол, парафин, тетра-гидронафталин, алкилированные нафталины или их производные, спирты, такие как метанол, этанол, пропанол, бутанол и циклогексанол, гликоли, кетоны, такие как циклогексанон и гамма-бутиролактон, диметиламиды жирных кислот, жирные кислоты и сложные эфиры жирных кислот и сильно полярные растворители, например, амины, такие как N-метилпирролидон.

Твердыми носителями являются минеральные земли, такие как силикаты, силикагели, тальк, каолины, известняк, известь, мел, боллус, лёсс, глины, доломит, диатомовая земля, сульфат кальция, сульфат магния, оксид магния, размолотые синтетические материалы, удобрения, такие как, например, сульфат аммония, фосфат аммония, нитрат аммония, мочевины и продукты растительного происхождения, такие как мука зерновых культур, мука древесной коры, древесная мука и мука ореховой скорлупы, целлюлозные порошки или другие твердые носители.

Пригодными поверхностно-активными веществами (адъюванты, смачивающие агенты, вещества для повышения клейкости, диспергаторы или эмульгаторы) являются соли щелочных, щелочноземельных металлов и аммониевые соли ароматических сульфоновых кислот, таких как, лигнинсульфоновая кислота (например, Borrespers®, Borregaard, Норвегия), фенолсульфоновые кислоты, нафталинсульфоновые кислоты (типы Morwet, Akzo Nobel, США) и дибутилнафталинсульфоновая кислота (типы Nekal, BASF SE, Германия), и кислот жирного ряда, алкилсульфонаты, алкиларилсульфонаты, алкилсульфаты, сульфаты простых лауриловых эфиров и сульфаты жирных спиртов, и соли сульфатированных гекса-, гепта- и октадеканолов, сульфатированные гликолевые эфиры спирта жирного ряда, кроме того, продукты конденсации нафталина или нафталинсульфоновой кислоты с фенолом и формальдегидом, полиоксипропиленоктилфениловый эфир, этоксилированный изооктилфенол, октилфенол, нонилфенол, алкилфенилполигликолевые эфиры, трибутилфенилполигликолевый эфир, тристеарилфенилполигликолевый эфир, алкиларилполиэфирные спирты, конденсаты окиси этилена и спирта жирного ряда, этоксилированное

касторовое масло, полиоксиэтиленалкиловые эфиры, этоксилированный полиоксипропилен, ацеталь полигликолевого эфира лаурилового спирта, сложные эфиры сорбита, лигнинсульфитные отработанные щелочи и белки, денатурированные белки, полисахариды (например, метилцеллюлоза), гидрофобно модифицированные крахмалы, поливиниловые спирты (типов Mowiol®, Clariant, Швейцария), поликарбоксилаты (типов Sokolan®, BASF, Германия), полиалкоксилаты, поливиниламины (типов Lupasol®, BASF, Германия), поливинилпирролидон и его сополимеры.

Примерами загустителей (т.е. соединений, которые придают составам модифицированную текучесть, т.е. высокую вязкость в состоянии покоя и низкую вязкость в подвижном состоянии) являются полисахариды и органические и неорганические глины, такие как ксантановая смола (Kelzan® CP Kelco, США), Rhodopol® 23 (Rhodia, Франция), Veegum® (R.T. Vanderbilt, США) или Attaclay® (Engelhard Corp., NJ, США).

Бактерициды могут быть добавлены для консервации и стабилизации состава. Примерами пригодных бактерицидов являются таковые на основе дихлорофена и хемиформала бензилового спирта (Proxel® от ICI или Acticide® RS от Thor Chemie и Kathon® MK от Rohm & Haas) и производные изотиазолинона, такие как алкилизотиазолиноны и бензизотиазолиноны (Acticide® MBS от Thor Chemie).

Примерами пригодных антифризов являются этиленгликоль, пропиленгликоль, мочевины и глицерин.

Примерами антивспенивателей являются силиконовые эмульсии (такие как, например, Silikon® SRE, Wacker, Германия или Rhodorsil®, Rhodia, Франция), длинноцепочечные спирты, жирные кислоты, соли жирных кислот, фторорганические соединения и их смеси.

Пригодными красителями являются малорастворимые в воде пигменты и растворимые в воде красители. Примерами являются Rhodamin B, С. I. пигмент красный 112 и С. I. сольвент красный 1, пигмент синий 15:4, пигмент синий 15:3, пигмент синий 15:2, пигмент синий 15:1, пигмент синий 80, пигмент желтый 1, пигмент желтый 13, пигмент красный 48:2, пигмент красный 48:1, пигмент красный 57:1, пигмент красный 53:1, пигмент оранжевый 43, пигмент оранжевый 34, пигмент оранжевый 5, пигмент зеленый 36, пигмент зеленый 7, пигмент белый 6, пигмент коричневый 25, основной фиолетовый 10, основной фиолетовый 49, кислотный красный 51, кислотный красный 52, кислотный красный 14, кислотный синий 9, кислотный желтый 23, основной красный 10, основной красный 108.

Примерами веществ для повышения клейкости или связующих веществ являются поливинилпирролидоны, поливинилацетаты, поливиниловые спирты и простые эфиры целлюлозы (Tylose®, Shin-Etsu, Япония).

Порошки, средства для рассеивания и тонкие порошки могут быть получены посредством смешивания или совместного размола композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II) как описано в настоящем изобретении и, при необходимости других активных веществ с по меньшей мере одним твердым носителем.

Гранулы, например, покрытые гранулы, пропитанные гранулы и гомогенные гранулы, могут быть получены посредством соединения композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II) как описано в настоящем изобретении с твердыми носителями. Примерами твердых носителей являются минеральные земли, такие как силикагели, силикаты, тальк, каолин, аттаглина, известняк, известь, мел, болос, лёсс, глина, доломит, диатомовая земля, сульфат кальция, сульфат магния, оксид магния, размолотые синтетические материалы, удобрения, такие как, например, сульфат аммония, фосфат аммония, нитрат аммония, мочевины и продукты растительного происхождения, такие как мука зерновых культур, мука древесной коры, древесная мука и мука ореховой скорлупы, целлюлозный порошок или другие твердые носители.

Примерами типов составов являются суспензии (SC, OD, FS), эмульгируемые концентраты (EC), эмульсии (EW, EO, ES), пасты, пастилки, смачиваемые порошки или тонкие порошки (WP, SP, SS, WS, DP, DS) или гранулы (GR, FG, GG, MG), которые могут быть водорастворимыми или смачиваемыми, а также гелевые составы для обработки материала для размножения растений, такого как семена (GF), здесь далее подробно проиллюстрировано ниже.

1. Типы композиций для разбавления с водой.

I. Водорастворимые концентраты (SL, LS).

10 частей по массе композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II) как описано в настоящем изобретении, растворяют в 90 частях по массе воды или водорастворимого растворителя. В качестве альтернативы добавляют смачивающие вещества или другие вспомогательные вещества. При разбавлении в воде активное вещество растворяется. Таким образом, получают состав с 10 мас. % содержанием активного вещества.

II. Диспергируемые концентраты (DC).

20 частей по массе композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II) как описано в настоящем изобретении, растворяют в 70 частях по массе циклогексанона с добавлением 10 частей по массе диспергатора, например, поливинилпирролидона. При разбавлении с водой образуется дисперсия. Содержание активного вещества составляет 20 мас. %.

III. Эмульгируемые концентраты (EC).

15 частей по массе композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II) как описано в настоящем изобретении, растворяют в 75 частей по массе ксилола с добавлением додецилбензолсульфоната кальция и этоксилата касторового масла (в каждом случае 5 частей по массе). При разбавлении с водой образуется эмульсия. Композиция содержит 15 мас. % активного вещества.

IV. Эмульсии (EW, EO, ES).

25 частей по массе композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II) как описано в настоящем изобретении, растворяют в 35 частей по массе ксилола с добавлением додецилбензолсульфоната кальция и этоксилата касторового масла (в каждом случае 5 частей по массе). Эту смесь вводят в 30 частей по массе воды при помощи эмульгирующего устройства (Ultraturax) и доводят до гомогенной эмульсии. При разбавлении с водой образуется эмульсия. Композиция содержит 25 мас. % активного вещества.

V. Суспензии (SC, OD, FS).

В шаровой мельнице с мешалкой 20 частей по массе композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II), как описано в настоящем изобретении, измельчают с добавлением 10 частей по массе диспергатора и смачивающих средств и 70 частей по массе воды или органического растворителя до тонкой суспензии активного вещества. При разбавлении с водой образуется стабильная суспензия активного вещества. Содержание активного вещества в композиции составляет 20 мас. %.

VI. Диспергируемые в воде гранулы и водорастворимые гранулы (WG, SG).

50 частей по массе композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II) как описано в настоящем изобретении, тонко измельчают при добавлении 50 частей по массе диспергаторов и смачивающих веществ и получают в виде диспергируемых в воде или водорастворимых гранул с помощью технических устройств (например, экструзионного устройства, распылительной башни, псевдооживленного слоя). При разбавлении в воде образуется стабильная дисперсия или раствор активного вещества. Композиция содержит 50 мас. % активного вещества.

VII. Диспергируемые в воде порошки и водорастворимые порошки (WP, SP, SS, WS).

75 частей по массе композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II) как описано в настоящем изобретении, перемалывают в роторнотаторной мельнице при добавлении 25 частей по массе диспергаторов, смачивающих веществ и силикагеля. При разбавлении в воде образуется стабильная дисперсия или раствор активного вещества. Содержание активного вещества в композиции составляет 75 мас. %.

VIII. Гель (GF).

В шаровой мельнице с мешалкой 20 частей по массе композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II) как описано в настоящем изобретении, измельчают с добавлением 10 частей по массе диспергаторов, 1 части по массе желирующего смачивающего средства и 70 частей по массе воды или органического растворителя до получения тонкой суспензии активного вещества. При разбавлении в воде образуется стабильная суспензия активного вещества, посредством чего получают композицию с содержанием 20 мас. % активного вещества.

2. Типы композиций для применения неразбавленными.

IX. Тонкие порошки (DP, DS).

5 частей по массе композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II) как описано в настоящем изобретении, тонко измельчают и тщательно перемешивают с 95 частями по массе тонкодисперсного каолина. Вследствие чего получают композицию для опыления с содержанием активного вещества 5 мас. %.

X. Гранулы (GR, FG, GG, MG).

0,5 частей по массе композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II) как описано в настоящем изобретении, тонко измельчают и связывают с 99,5 частей по массе носителей. При этом обычным способом является экструзия, распылительная сушка или псевдооживленный слой. Вследствие чего получают гранулы для применения неразбавленными с содержанием активного вещества 0,5 мас. %.

XI. Растворы ULV (UL).

10 частей по массе композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II) как описано в настоящем изобретении растворяют в 90 частях по массе органического растворителя, например, ксилола. Вследствие чего получают композицию для применения неразбавленной с содержанием активного вещества 10 мас. %.

Агрохимические составы, как правило, содержат от 0,01 до 95, предпочтительно от 0,1 до 90, наиболее предпочтительно от 0,5 до 90 мас. % активных веществ.

Композиция, содержащая мефентрифлуконазол (I) и соединение (II), как описано в настоящем изобретении, может быть применена как таковая или в виде ее композиций, например, в виде растворов для непосредственного опрыскивания, порошков, суспензий, дисперсий, эмульсий, масляных дисперсий, паст, тонких порошков, материалов для разбрасывания, или гранул путем опрыскивания, мелкокапельного опрыскивания, опыливания, разбрасывания, нанесения щёткой, окунания или полива. Формы применения полностью зависят от предполагаемых целей; в любом случае необходимо обеспечить наилучшее

распределение соединений, присутствующих в композиции, которая содержит мефентрифлуконазол (I) и по меньшей мере одно соединение (II), как описано в настоящем изобретении.

Водные формы применения могут быть приготовлены из эмульсионных концентратов, паст, смачиваемых порошков (порошков для распыления, масляных дисперсий) посредством добавления воды. Для приготовления эмульсий, паст или масляных дисперсий вещества, как таковые или растворенные в масле или растворителе, могут быть гомогенизированы в воде с помощью смачивающих средств, веществ для повышения клейкости, диспергаторов или эмульгаторов. В качестве альтернативы можно приготовить концентраты, состоящие из активного вещества, смачивающего средства, вещества для повышения клейкости, диспергатора или эмульгатора и, при необходимости, растворителя или масла, и такие концентраты подходят для разбавления водой.

Концентрации активного вещества в готовых к применению препаратах могут варьироваться в относительно широких пределах. Как правило, они составляют от 0,0001 до 10, предпочтительно от 0,001 до 1 мас. % композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II), как описано в настоящем изобретении.

Композиция, содержащая мефентрифлуконазол (I) и одно соединение (II), как описано в настоящем изобретении, также может быть результативно использована в способе со сверхмалым объемом (ULV), причем возможно вносить композиции, содержащие более 95 мас. % активного вещества, или даже применять активное вещество без добавок.

К активным соединениям, содержащим мефентрифлуконазол (I) и по соединению (II), как описано в настоящем изобретении, могут быть добавлены различные типы масел, смачивающие средства, адъюванты, гербициды, фунгициды, другие пестициды, или бактерициды, при необходимости только непосредственно перед применением (смесь в баке). Эти средства могут быть смешаны с композицией, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II), как описано в настоящем изобретении, в массовом соотношении от 1:100 до 100:1, предпочтительно от 1:10 до 10:1.

Композиции в соответствии с настоящим изобретением также могут содержать удобрения, такие как нитрат аммония, мочевины, углекислый калий и суперфосфат, фитотоксические вещества и регуляторы роста, и сафенеры. Их можно применять последовательно или в сочетании с описанными выше композициями, при необходимости также могут быть добавлены только непосредственно перед применением (смесь в баке). Например, растение(я) могут быть опрысканы композицией в соответствии с настоящим изобретением или перед, или после его обработки удобрениями.

Композиции наносят путем обработки грибов или растений, материалов для размножения растений (предпочтительно семян), материалов или почвы, которые должны быть защищены от поражения грибами, пестицидно эффективным количеством композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II), как описано в настоящем изобретении. Применение может быть осуществлено как до, так и после заражения вредителями материалов, растений или материалов для размножения растений (предпочтительно семян).

Как правило, понятие "пестицидно эффективное количество" означает количество композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II), как описано в настоящем изобретении или композиций, содержащих композицию, которая включает в себя мефентрифлуконазол (I) и соединение (II), как описано в настоящем изобретении, необходимое для достижения видимого воздействия на рост, включая эффекты некроза, гибели, замедления, предотвращения и удаления, разрушения или иного уменьшения появления и активности целевого организма. Пестицидно эффективное количество может варьироваться. Пестицидно эффективное количество также будет варьироваться в зависимости от преобладающих условий, таких как желаемый пестицидный эффект и продолжительность, погода, целевые виды, место расположения, способ применения и т.п.

При приготовлении композиций, содержащих композицию, которая содержит мефентрифлуконазол (I) и соединение (II), как описано в настоящем изобретении, предпочтительно использовать чистое активное соединение, к которому, в качестве дополнительных активных компонентов в соответствии с необходимостью, необязательно могут быть добавлены дополнительные активные соединения против вредителей, такие как инсектициды, гербициды, фунгициды или другие гербицидные или регулирующие рост активные соединения или удобрения.

Предпочтительно, чтобы композиция, содержащая мефентрифлуконазол (I) и соединение (II), как описано в настоящем изобретении, была использована для обработки грибов или растений или почвы, которые должны быть защищены от пестицидного нападения, посредством внекорневой обработки пестицидно эффективным количеством композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II), как описано в настоящем изобретении. Также, в данном случае, применение можно осуществлять как до, так и после заражения растений вредителями.

В способе борьбы с вредными грибами, в зависимости от типа соединения и желаемого эффекта, нормы внесения композиции, содержащей мефентрифлуконазол (I) и соединение (II), как описано в настоящем изобретении, составляют от 0,1 до 10000, предпочтительно от 2 до 2500, более предпочтительно от 5 до 1000, наиболее предпочтительно от 10 до 750, в частности от 20 до 700 г/га.

В альтернативном варианте осуществления изобретения композицию, содержащую мефентрифлу-

коназол (I) и соединение (II), как описано в настоящем изобретении, применяют для защиты семян и корней и побегов проростков, предпочтительно семян, как указано выше.

Композиции, которые в особенности пригодны для обработки семян, представляют собой, например:

- A) растворимые концентраты (SL, LS);
- D) эмульсии (EW, EO, ES);
- E) суспензии (SC, OD, FS);
- F) диспергируемые в воде и водорастворимые гранулы (WG, SG);
- G) диспергируемые в воде и водорастворимые порошки (WP, SP, WS);
- H) гелевые составы (GF);
- I) тонкие порошки (DP, DS).

Эти композиции могут быть применены на материалах для размножения растений, в частности семенах, разбавленными или неразбавленными. Данные композиции после от двух- до десятикратного разведения дают концентрации активного вещества от 0,01 до 60, предпочтительно от 0,1 до 40 мас. %, в готовых к применению препаратах. Применение может быть осуществлено до или во время посева. Способы применения или обработки агрохимических соединений и соответственно их композиций, на материале для размножения растений, в особенности семенах, известны из уровня техники, и включают в себя способы протравливания, покрытия, пеллетирования, опыливания и пропитывания материала для размножения (а также при обработке борозд). В предпочтительном варианте осуществления соединения или их композиции, соответственно, наносят на материал для размножения растений таким способом, который не вызывает прорастания, например, посредством протравливания, пеллетирования, покрытия и опыливания семян.

При обработке материала для размножения растений (предпочтительно семян) нормы внесения смеси в соответствии с изобретением обычно соответствуют нормам для приготовленного продукта (который обычно содержит от 10 до 750 г/л активного (-ых) вещества.

Изобретение также относится к продуктам размножения растений, и в особенности, к семенам, включающим, то есть покрытым посредством и/или содержащим смесь, как определено выше или композицию, содержащую смесь из двух или большего количества активных веществ, или смесь из двух или большего количества композиций, каждая из которых содержит одно из активных веществ. Материал для размножения растений (предпочтительно семена) включает композицию, содержащую мефентрифлуконазол (I) и соединение (II) как описано в настоящем изобретении в количестве от 0,1 г до 10 кг на 100 кг материала для размножения растений (предпочтительно семян), предпочтительно от 0,1 г до 1 кг на 100 кг материала для размножения растений (предпочтительно семян).

Изобретение дополнительно проиллюстрировано, но не ограничено следующими практическими примерами:

- экспериментальная часть;
- тест в теплице.

Соединения растворяли в смеси ацетона и/или диметилсульфоксида и смачивающего средства/эмульгатора Wettol, который основан на этоксилированных алкилфенолах, в соотношении (по объему) растворитель-эмульгатор 99:1, чтобы получить общий объем 5 мл. Затем добавляли воду до общего объема 100 мл. Этот исходный раствор затем разбавляли описанной смесью растворитель-эмульгатор-вода до конечной концентрации, указанной в таблице ниже.

Профилактическая фунгицидная борьба с белой плесенью на масличном рапсе, вызванной посредством *Sclerotinia sclerotiorum* (SCLESC K2)

Масличный рапс выращивали в горшках до стадии 13-14 листьев. Лепестки рапса фиксировали посредством 25 мкл 2,5% метилцеллюлозы на листе 1 и 2. 25 мкл суспензии спор *Sclerotinia sclerotiorum* пипетировали на каждый фиксированный лепесток рапса. Растения переносили на 2 дня в тепличную камеру при 20°C и влажности 60%. Затем эти растения опрыскивали до образования капель ранее описанным раствором для опрыскивания, содержащим активные вещества или их смесь в концентрации, указанной в таблице ниже. Опытные растения сразу же снова переносили в тепличную камеру. Через 14 дней степень поражения грибами листьев оценивали визуально как % пораженной площади листа.

Профилактическая фунгицидная борьба с белой плесенью на масличном рапсе, вызванной посредством *Sclerotinia sclerotiorum* (SCLESC P3)

Масличный рапс выращивали в горшках до стадии 13-14 листьев. Эти растения опрыскивали до образования капель ранее описанным раствором для опрыскивания, содержащим активные вещества или их смесь в концентрации, указанной в таблице ниже. Растениям давали высохнуть на воздухе. Через три дня обработанные лепестки рапса фиксировали посредством 25 мкл 2,5% метилцеллюлозы на листе 1 и 2. 25 мкл суспензии спор *Sclerotinia sclerotiorum* пипетировали на каждый фиксированный лепесток рапса. Через 14 дней при 20°C и относительной влажности 60% степень поражения грибами листьев оценивали визуально как % пораженной площади листа.

Оценки заболеваний были преобразованы в эффективность. Эффективность 0 означает, что уровень

заражения обработанных растений соответствует уровню заражения необработанных контрольных растений; эффективность 100 означает, что обработанные растения не были заражены.

Ожидаемую эффективность смесей активных веществ определяли с использованием формулы Колби [R.S. Colby, "Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide combinations", Weeds 15, 20-22 (1967)] и сравнивали с наблюдаемой эффективностью.

SCLESC K2

Активное вещество	Норма а.в. (г/га)	Смесь	Наблюдаемая эффективность	Рассчитанная эффективность	Синергизм
Необработанный контроль	-	-	100 % заболеваемости		
I	50	-	52		
II-9	12,5	-	69		
I + II-9	50 + 12,5	4 : 1	96	85	11

SCLESC P3

Активное соединение/ активная смесь	Норма а.в. (г/га)	Смесь	Наблюдаемая эффективность	Рассчитанная эффективность	Синергизм
Необработанный контроль	-	-	100 % заболеваемости		
I	50	-	28		
II-9	12,5	-	74		
I + II-9	50 + 12,5	4 : 1	100	81	19

Полевые испытания.

Активность против *Sclerotinia sclerotiorum* в полевых испытаниях Испытание проводили в полевых условиях. Семена рапса высаживали и выращивали в стандартных условиях с достаточным запасом воды и питательных веществ. На стадии роста 63-67 применение соединений осуществляли однократно. Никакие другие соединения для борьбы с патогенами не применяли. Заражение патогенами происходило естественным путем. Заболеваемость оценивали через 56 дней после первого применения (Sclesc).

Заболевания преобразовывали в эффективность. Эффективность 0 означает, что уровень заражения обработанных растений соответствует уровню заражения необработанных контрольных растений; эффективность 100 означает, что обработанные растения не были заражены.

Ожидаемую эффективность смесей активных веществ определяли по формуле Колби [R.S. Colby, "Calculating synergistic и antagonistic responses of herbicide combinations", Weeds 15, 20-22 (1967)] и сравнивали с наблюдаемой эффективностью.

Sclesc

Активное вещество	Норма внесения (г/га)	Смесь	Наблюдаемая эффективность	Рассчитанная эффективность	Синергизм
Необработанный контроль	-	-	80 % заболеваемости		
I	100	-	32		
	150	-	32		
II-1	200	-	37		
II-2	60	-	15		
I + II-1	100 + 300	1 : 3	76	57	19
I + II-2	150 + 60	2,5 : 1	76	42	34

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Способ борьбы с фитопатогенными грибами, выбранными из *Sclerotinia* spp., в масличном рапсе или каноле, включающий обработку растений, их семян или почвы фунгицидно эффективным количеством композиции, содержащей:

I) мефентрифлуконазол или его приемлемые в сельском хозяйстве соли в виде соединения (I);

II) боскарид или его приемлемые в сельском хозяйстве соли в виде соединения (II).

2. Способ по п.1, в котором композицию наносят на растения.

3. Способ по п.1, в котором композицию наносят на почву.

4. Способ по п.1, в котором композицию наносят на семена растений.

5. Способ по любому из пп.1-4, в котором фитопатогенными грибами является *Sclerotinia sclerotiorum*.

6. Способ по любому из пп.1-5, в котором композицию наносят в количестве от 5 до 2500 г/га.

7. Способ по п.4, в котором композицию наносят на семена в количестве от 0,01 г до 10 кг на 100 кг.

8. Применение композиции, охарактеризованной в п.1, для борьбы с фитопатогенными грибами,

выбранными из *Sclerotinia* spp. в масличном рапсе или каноле.

9. Применение по п. 8, где фитопатогенными грибами является *Sclerotinia sclerotiorum*.



Евразийская патентная организация, ЕАПВ

Россия, 109012, Москва, Малый Черкасский пер., 2
