



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **110577** (13) **C2**  
(51) МПК (2015.01)  
**A01N 43/653** (2006.01)  
**A01N 43/56** (2006.01)  
**A01P 3/00**

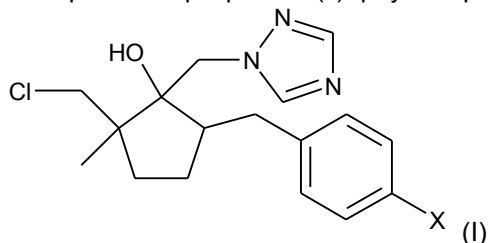
ДЕРЖАВНА СЛУЖБА  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ  
УКРАЇНИ

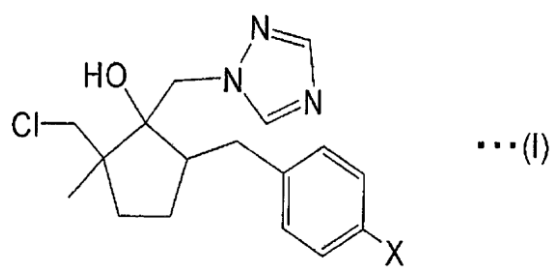
**(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД**

<b>(21)</b> Номер заявки:	<b>а 2014 12794</b>	<b>(72)</b> Винахідник(и):	<b>Татеісі Хідеакі (JP), Гроте Томас (DE), Діц Йохен (DE), Монтаг Юріт (DE), Хаден Егон (DE)</b>
<b>(22)</b> Дата подання заявки:	<b>12.09.2013</b>	<b>(73)</b> Власник(и):	<b>КУРЕХА КОРПОРЕЙШН, 3-3-2, Nihonbashi-Hamacho, Chuo-ku, Tokyo 1038552, Japan (JP)</b>
<b>(24)</b> Дата, з якої є чинними права на винахід:	<b>12.01.2016</b>	<b>(74)</b> Представник:	<b>Мошинська Ніна Миколаївна, реєстр. №115</b>
<b>(31)</b> Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	<b>2012-228346</b>	<b>(56)</b> Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	<b>JP 2008530059, A, 07.08.2008 WO 2012069514, A, 31.05.2012 CA 2722729, A, 12.11.2009 WO 2011070771, A, 16.06.2011</b>
<b>(32)</b> Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	<b>15.10.2012</b>		
<b>(33)</b> Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	<b>JP</b>		
<b>(41)</b> Публікація відомостей про заявку:	<b>12.01.2015, Бюл.№ 1</b>		
<b>(46)</b> Публікація відомостей про видачу патенту:	<b>12.01.2016, Бюл.№ 1</b>		
<b>(86)</b> Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	<b>PCT/JP2013/005423, 12.09.2013</b>		

**(54) АГЕНТ ДЛЯ БОРОТЬБИ З ЗАХВОРЮВАННЯМИ РОСЛИН, СПОСІБ БОРОТЬБИ З ЗАХВОРЮВАННЯМИ РОСЛИН І ПРОДУКТ ДЛЯ БОРОТЬБИ З ЗАХВОРЮВАННЯМИ****(57) Реферат:**

Агент для боротьби з захворюваннями рослин, який має малий вміст активного інгредієнта, що містить як активні інгредієнти: (i) сполуку триазолу, представлену загальною формулою (I), де X є хлором або фтором та (ii) флуксапіроксад.

**UA 110577 C2**



Галузь Техніки

[0001] Цей винахід стосується агента для боротьби з захворюваннями рослин, способу боротьби з захворюваннями рослин і продукту для боротьби з захворюваннями рослин. Більш детально цей винахід стосується композиції для боротьби з захворюваннями рослин, яка містить два види активних інгредієнтів, способу боротьби з захворюваннями рослин, який використовує композицію для боротьби з захворюваннями рослин, та продуктів для боротьби з захворюваннями рослин, які містять два відповідних види активних інгредієнтів.

Рівень техніки

[0002] Патентна література 1 описує похідне 2-(галоген-вуглеводень-заміщеного)-5-бензил-1-азолілметилциклопентанолу у вигляді сполуки, яку можна використати як активний інгредієнт агента, такого як агент агро-садівництва або агент, що захищає промисловий матеріал.

[0003] Патентна література 2 описує похідне аніліду піразолкарбонової кислоти, яке можна використати для боротьби зі шкідливими мікроорганізмами.

Список літератури

Патентна література

[0004] [Патентна література 1 (PTL 1)] Міжнародна публікація № WO2011/070771 (дата публікації: 16 червня, 2011 р.)

[Патентна література 2 (PTL 2)] Переклад японською міжнародної заявки згідно Договору про патентну кооперацію (РСТ), Tokuhyo № 2008-530059 А (дата публікації: 7 серпня 2008 р.)

Суть винаходу

Технічна задача

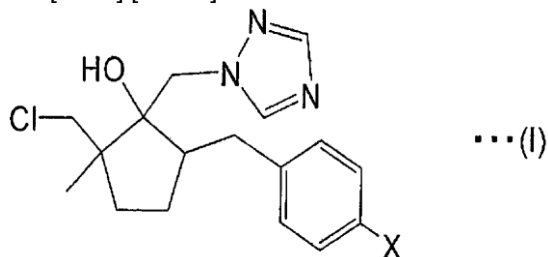
[0005] Протидія захворюванням, яку здійснюють шляхом використання агента для боротьби з захворюваннями рослин, охоплює такі проблеми, як (i) вплив на нецільові організми, (ii) вплив на довкілля та (iii) поява стійких до фунгіцидів збудників. Таким чином, існує великий попит на хімічні речовини, які можуть продемонструвати значний ефект протидії із зниженою кількістю розпиливаних хімікатів з метою зниження токсичності для нецільових організмів, негативного впливу на довкілля та частоти появи стійких до фунгіцидів збудників.

[0006] Цей винахід було розроблено з урахуванням зазначених проблем, і основне його призначення полягає у створенні агента для боротьби з захворюваннями рослин, який демонструє ефект, еквівалентний такому при використанні звичайних хімічних речовин, незважаючи на те, що кількість спрею агента для боротьби з захворюваннями рослин, є меншою, ніж при використанні звичайних хімічних речовин.

Вирішення задачі

[0007] З метою вирішення зазначеної задачі передбачений цим винаходом агент для боротьби з захворюваннями рослин має містити в якості активних інгредієнтів (i) флуксапіроксад та (ii) сполуку триазолу, представлену загальною формулою (I),

[0008] [Хім. 1]

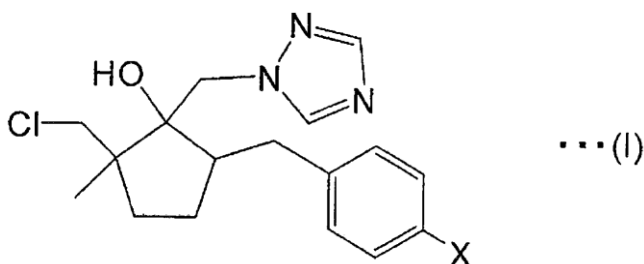


[0009] де X представляє атом хлору або атом фтору.

[0010] З метою вирішення зазначеної задачі передбачений цим винаходом спосіб боротьби з захворюваннями рослин має включати стадію проведення обробки листя або проведення обробки відмінних від листя об'єктів з використанням агента для боротьби з захворюваннями рослин.

[0011] З метою вирішення зазначеної задачі передбачений цим винаходом продукт для боротьби з захворюваннями рослин, має окремо містити флуксапіроксад і сполуку триазолу, представлену загальною формулою (I),

[0012] [Хім. 2]



[0013] де X представляє атом хлору або атом фтору;  
флуксапіроксад і сполука триазолу є активними інгредієнтами, які перед використанням  
треба змішати один з одним.

5 Корисні ефекти винаходу

[0014] Передбачений цим винаходом агент для боротьби з захворюваннями рослин, містить  
два види сполук, таким чином демонструючи великий синергічний ефект протидії.

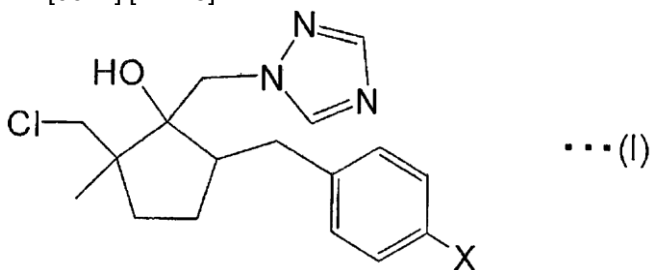
Опис варіантів втілення

[0015] У наступному описі розглядатиметься варіант втілення цього винаходу.

10 [0016] (Активний інгредієнт)

Передбачений цим винаходом агент для боротьби з захворюваннями рослин є так званою  
домішкою і містить в якості активних інгредієнтів флуксапіроксад і сполуку триазолу,  
представлену наступною загальною формулою (I) (далі — сполука триазолу (I)),

[0017] [Хім. 3]



15

[0018] де X представляє атом хлору або атом фтору.

[0019] Сполука триазолу (I) утворює (i) сіль приєднання кислоти, до якої додають  
неорганічну чи органічну кислоту або (ii) комплекс металу, оскільки сполука триазолу (I) має  
1,2,4-триазольну групу. Отримані таким чином сіль приєднання кислоти або комплекс металу  
можна використати в якості сполуки триазолу (I).

20

[0020] Сполука триазолу (I) містить три асиметрично розташовані атоми вуглецю. Таким  
чином, сполука триазолу (I) має різні стереоізомери (енантіомери або діастереомери) і, залежно  
від її композиції, складається з суміші стереоізомерів або одиначного стереоізомера. Таким  
чином, в якості активного інгредієнта агента для боротьби з захворюваннями рослин можна  
використовувати принаймні один з стереоізомерів.

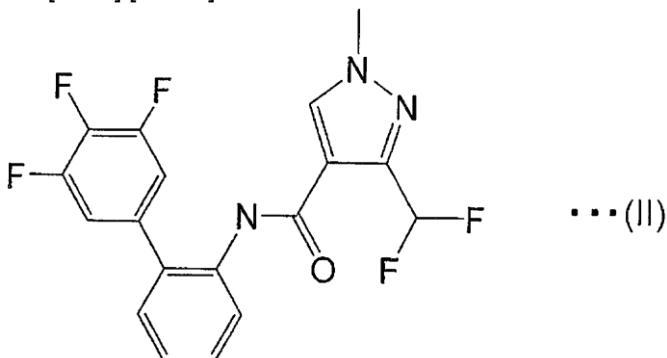
25

[0021] Сполуку триазолу (I) можна отримати за допомогою традиційного добре відомого  
способу, такого як спосіб, розкритий у Патентній літературі 1.

[0022] Флуксапіроксад — це загальна назва 3-(дифторметил)-1-метил-N-(3', 4', 5'-  
трифлуоробіфеніл-2-іл)піразол-4-карбоксамідів і є сполукою, представленою наступною  
загальною формулою (II).

30

[0023] [Хім. 4]



[0024] Флуксапіроксад можна отримати за допомогою традиційних добре відомих способів,  
таких як спосіб, розкритий у Патентній літературі 2.

[0025] Сполука триазолу (I) і флуксапіроксад демонструють ефект протидії захворюванням рослин різних сільськогосподарських культур. Агент для боротьби з захворюваннями рослин, який містить сполуку триазолу (I) і флуксапіроксад, демонструє синергічний ефект порівняно з агентом для боротьби з захворюваннями рослин, який містить тільки сполуку триазолу (I) або флуксапіроксад.

[0026] Для демонстрації синергічного ефекту співвідношення сполуки триазолу (I) та флуксапіроксаду в суміші може варіюватися у широкому діапазоні. Наприклад, співвідношення суміші за масою може варіюватися від 1000:1 до 1:1000 (переважніше — від 100:1 до 1:100). Зокрема, співвідношення суміші переважніше має варіюватися від 20:1 до 1:80 (найпереважніше — від 2:1 до 1:8).

[0027] (Агент для боротьби з захворюваннями рослин)

Агент для боротьби з захворюваннями рослин, на доповнення до сполуки триазолу (I) і флуксапіроксаду, може містити у своїй композиції інший допоміжний агент, такий як твердий носій, носій суспензії (розчинник) або поверхнево-активна речовина. Таким чином, агент для боротьби з захворюваннями рослин може бути в різних лікарських формах, таких як пилоподібна композиція, змочуваний порошок, гранули або концентрат для емульгації.

[0028] Загальна кількість сполуки триазолу (I) і флуксапіроксаду в агенті для боротьби з захворюваннями рослин переважно становить від 0,1 % до 95 % за масою, переважніше — від 0,5 % до 90 % за масою і найпереважніше — від 2 % до 80 % за масою агента для боротьби з захворюваннями рослин.

[0029] Приклади твердого носія, який використовують в якості допоміжного агента у композиції, включають тальк, каолін, бентоніт, діатоміт, білу сажу та глину. Приклади носія суспензії, який використовують в якості допоміжного агента у композиції, включають воду, ксилол, толуол, хлорбензол, циклогексан, циклогексанон, диметилсульфоксид, диметилформамід і спирт. Поверхнево-активну речовину можна використати в залежності від її ефекту. У випадку, коли агент для боротьби з захворюваннями рослин є концентратом, який можна емульгувати, в якості поверхнево-активної речовини можна використати, наприклад, поліоксиетиленалкларилловий ефір або поліоксиетиленсорбітанмонолаурат. У випадку, коли агент для боротьби з захворюваннями рослин є диспергатором, в якості поверхнево-активної речовини можна використати, наприклад, лігнінсульфонат або дибутилнафталінсульфонат. У випадку, коли агент для боротьби з захворюваннями рослин є змочувальним агентом, в якості поверхнево-активної речовини можна використати, наприклад, алкілсульфонат або алкілфенілсульфонат.

[0030] Агент для боротьби з захворюваннями рослин можна використати як є. В якості альтернативи агент для боротьби з захворюваннями рослин можна використати після розведення розчинником, таким як вода, для отримання заданої концентрації. Слід зазначити, що у випадку, коли використовують таким чином розведений агент для боротьби з захворюваннями рослин, він переважно містить активні інгредієнти, загальна концентрація яких варіює в межах від 0,001 % до 1,0 % відносно загальної кількості розведеного таким чином агента для боротьби з захворюваннями рослин.

[0031] Оскільки агент для боротьби з захворюваннями рослин демонструє синергічний ефект протидії, можна зменшити кількість активного інгредієнта, який використовуватимуть для демонстрації ефекту, еквівалентного такому, який продемонстрував агент для боротьби з захворюваннями рослин, що містить тільки сполуку триазолу (I) або флуксапіроксад. Це дає можливість зменшити токсичність для нецільових організмів і негативний вплив на довкілля. Можливо також зменшити кількість сполуки триазолу (I) і флуксапіроксаду, які використовуватимуть. Тому очікується зниження частоти появи стійких до фунгіцидів збудників. Додатково, передбачений цим варіантом втілення агент для боротьби з захворюваннями рослин в якості активних інгредієнтів, які демонструють ефект протидії захворюванням рослин, містить два активних інгредієнти, які значно відрізняються один від одного за молекулярною структурою. Це дозволяє агенту для боротьби з захворюваннями рослин протидіяти широкому спектру захворювань.

[0032] Агент для боротьби з захворюваннями рослин можна отримати шляхом змішування агентів, які окремо підготовлені так, щоб вони мали відповідний вміст активних інгредієнтів. Таким чином, цей винахід охоплює продукт для боротьби з захворюваннями рослин, що включає сполуку триазолу (I) і флуксапіроксад у вигляді окремих препаратів, які треба змішати один з одним перед застосуванням з метою боротьби з захворюваннями рослин.

[0033] (Ефект протидії захворюванням рослин)

Передбачений цим винаходом агент для боротьби з захворюваннями рослин демонструє ефект протидії широкому спектру захворювань рослин. Нижче описані приклади захворювань,

яким повинен протидіяти передбачений цим винаходом агент для боротьби з захворюваннями рослин.

[0034] Агент для боротьби з захворюваннями рослин протидіє таким захворюванням пшениці, як борошниста роса пшениці (*Erysiphe graminis* f. sp. tritici), бура іржа пшениці (*Puccinia recondita*), жовта іржа пшениці (*Puccinia striiformis*), вічкова плямистість пшениці (*Pseudocercospora herpotrichoides*), фузаріоз колоса пшениці (*Fusarium graminearum*, *Microdochium nivale*), септоріоз колоскової луски пшениці (*Phaeosphaeria nodorum*), септоріоз листя пшениці (*Septoria tritici*), фузаріозна снігова пліснява пшениці (*Microdochium nivale*), офіоболезна коренева гниль (*Gaeumannomyces graminis*), чорнь колоса пшениці (*Epicoccum* spp) і піренофороз (жовта плямистість пшениці) (*Pyrenophora tritici-repentis*).

[0035] Агент для боротьби з захворюваннями рослин також протидіє таким захворюванням рослин, як іржа сої (*Phakopsora pachyrhizi*, *Phakopsora meibomiae*), пірікуляріоз рису (*Pyricularia grisea*), бура плямистість рису (*Cochliobolus miyabeanus*), бактеріальний опік рису (*Xanthomonas oryzae*), ризоктоніоз рису (*Rhizoctonia solani*), стеблова гниль рису (*Helminthosporium sigmoideum*), гіберельоз рису (*Gibberella fujikuroi*), стовбурова гниль рису (*Pythium arhanidermatum*), борошниста роса яблуні (*Podosphaera leucotricha*), парша яблуні (*Venturia inaequalis*), моніальна гниль (*Monilinia Mali*), альтернатіоз яблуні (*Alternaria alternata*), некроз яблуні (*Valsa mali*), чорна плямистість груші (*Alternaria kikuchiana*), борошниста роса груші (*Phyllactinia pyri*), іржа груші (*Gymnosporangium asiaticum*), парша груші (*Venturia nashicola*), борошниста роса винограду (*Uncinula necator*), мілдь винограду (*Plasmopara viticola*), гломерелльозна гниль ягід винограду (*Glomerella cingulata*), борошниста роса ячменю (*Erysiphe graminis* f. sp. hordei), стеблова іржа ячменю (*Puccinia graminis*), жовта іржа ячменю (*Puccinia striiformis*), смугастість ячменю (*Pyrenophora graminea*), ринхоспоріоз ячменю (*Rhynchosporium secalis*), борошниста роса гарбуза (*Sphaerotheca fuliginea*), антракноз гарбуза (*Colletotrichum lagenarium*), борошниста роса огірків (*Pseudoperonospora cubensis*), фітофтора огірків (*Phytophthora capsici*), борошниста роса помідорів (*Erysiphe cichoracearum*), альтернатіоз помідорів (*Alternaria solani*), борошниста роса баклажанів (*Erysiphe cichoracearum*), борошниста роса полуниці (*Sphaerotheca humuli*), борошниста роса тютюну (*Erysiphe cichoracearum*), церкоспороз цукрових буряків (*Cercospora beticola*), пухирчаста сажка кукурудзи (*Ustilago maydis*), бура гниль сливи (*Monilinia fructicola*), сіра гниль, яка уражує різні рослини (*Botrytis cinerea*), склеротініоз (*Sclerotinia sclerotiorum*), летюча сажка ячменю (*Ustilago Nuda*), іржа винограду (*Phakopsora ampelopsidis*), коричнева плямистість тютюну (*Alternaria longipes*), альтернатіоз картоплі (*Alternaria solani*), септоріоз сої (*Septoria glycines*), пурпурний церкоспороз сої (*Cercospora kikuchii*), фузаріозне в'янення кавуна (*Fusarium oxysporum* f.sp.niveum), фузаріозне в'янення огірка (*Fusarium oxysporum* f.sp.cucumerinum), синя цвіль цитрусових (*Penicillium italicum*), фузаріозне в'янення редису (*Fusarium oxysporum* f.sp.raphani), антракноз кукурудзи (*Colletotrichum graminicola*), вічкова плямистість кукурудзи (*Kabatella zeae*), сіра плямистість листя кукурудзи (*Cercospora zeae-maydis*), жовта плямистість листя кукурудзи (*Setosphaeria Turcica*), плямистість листя кукурудзи (*Cochliobolus carbonum*), бура плямистість листя кукурудзи (*Physoderma maydis*), іржа кукурудзи (*Puccinia* spp), коричнева плямистість кукурудзи (*Bipolaris maydis*), жовта плямистість кукурудзи (*Phyllosticta maydis*), фузаріоз качана кукурудзи (*Gibberella zeae*), телеоморфа ячменю (*Pyrenophora teres*), фузаріоз колоса ячменю (*Fusarium graminearum*, *Microdochium nivale*) та іржа цукрової тростини (*Puccinia* spp).

[0036] Передбачений цим винаходом агент для боротьби з захворюваннями рослин демонструє надзвичайно сильний ефект протидії зазначеним вище захворюванням пшениці. Тому агент для боротьби з захворюваннями рослин відповідним чином використовують для боротьби з захворюваннями пшениці. Однак застосування агента для боротьби з захворюваннями рослин не обмежується цим.

[0037] Приклади застосованих рослин включають (i) дикорослі рослини, (ii) культивовані сорти рослин, (iii) рослини і культивовані сорти рослин, отримані за допомогою звичайного біологічного розмноження, такого як схрещування або злиття протопластів, і (iv) генетично модифіковані рослини, а також генетично модифіковані культивовані сорти рослин, отримані за допомогою генної інженерії. Приклади генетично модифікованих рослин і генетично модифікованих культивованих сортів рослин включають (i) культури, стійкі до гербіцидів; (ii) культури, стійкі до комах-паразитів, в які інтегровані гени продукції інсектицидного білка, (iii) культури, стійкі до захворювань, в які інтегровані гени продукції індукторів стійкості до захворювань, (iv) культури з покращеними смаковими якість, (v) культури з підвищеною продуктивністю та (vi) культури з покращеними властивостями при зберіганні. Більш специфічні приклади генетично модифікованих культурних сортів рослин включають ROUNDUP READY, LIBERTYLINK, CLEARFIELD, YIELDGARD, HERCULEX і BOLLGARD, кожен з яких є

zareєстрованим товарним знаком.

[0038] (Спосіб боротьби з захворюваннями рослин)

Передбачений цим винаходом агент для боротьби з захворюваннями рослин можна використати не тільки для обробки листя шляхом нанесення на листя, але і для обробки відмінних від листя об'єктів, як от для обробки насіння, ґрунту або поверхні води. Таким чином, передбачений цим винаходом спосіб боротьби з захворюваннями рослин включає стадію проведення обробки листя або відмінних від листя об'єктів з використанням агента для боротьби з захворюваннями рослин. Слід зазначити, що обробка відмінних від листя об'єктів може зменшити трудовитрати порівняно з обробкою листя.

[0039] Для обробки насіння агент для боротьби з захворюваннями рослин приклеюють до насіння шляхом, наприклад, (i) змішування пилоподібної композиції або змочуваного порошку агента для боротьби з захворюваннями рослин з насінням, а потім їхнього перемішування або (ii) занурення насіння в суспензію змочуваного порошку агента для боротьби з захворюваннями рослин. Загальна кількість активних інгредієнтів, які будуть використовуватися, із розрахунку на 100 кг насіння при його обробці, варіюється, наприклад, в межах від 0,01 г до 10 000 г (переважніше — в межах від 0,1 г до 1000 г). Насіння, до якого приклеєний агент для боротьби з захворюваннями рослин, можна використати таким же чином, як нормальне насіння.

[0040] Наприклад, при обробці ґрунту шляхом змочування (i) агент для боротьби з захворюваннями рослин (i) кладуть в ямки, в які висаджують саджанці, або (ii) розпилюють навколо ямок. Наприклад, в якості альтернативи гранули і змочуваний порошок агента для боротьби з захворюваннями рослин вводять в ґрунт навколо насіння або рослин. Загальна кількість активних інгредієнтів, які будуть використовуватися для кожного квадратного метра агро-садівничої землі при обробці ґрунту шляхом змочування, варіюється, наприклад, в межах від 0,01 г до 10 000 г (переважніше — в межах від 0,1 г до 1000 г).

[0041] Наприклад, при обробці поверхні води гранули агента для боротьби з захворюваннями рослин вводять у воду зрошуваних полів. Загальна кількість активних інгредієнтів, які будуть використовуватися на десяти акрах зрошуваних полів для обробки поверхні води варіюється, наприклад, в межах від 0,1 г до 10 000 г (переважніше — в межах від 1 г до 1000 г).

[0042] Загальна кількість активних інгредієнтів, які будуть використовуватися для кожного гектара агро-садівничої землі, наприклад, поля, рисового поля, саду або оранжереї, при обробці листя варіюється, наприклад, в межах від 20 г до 5000 г (переважніше — в межах від 50 г до 2000 г).

[0043] Слід зазначити, що кількість і концентрація активних інгредієнтів, які будуть використовуватися, варіюватиметься залежно від таких умов, як (i) форма дозування активних інгредієнтів, (ii) час їхнього використання, (iii), спосіб їхнього використання, (iv), місце їхнього використання та (v) цільові культури, для яких вони використовуються. Таким чином, кількість активних інгредієнтів, які будуть використовуватися, не обмежується описаною вище кількістю, а може бути збільшена чи зменшена поза зазначених діапазонів.

[0044] (Суть винаходу)

Передбачений цим винаходом агент для боротьби з захворюваннями рослин містить в якості активних інгредієнтів (i) флуксапіроксад і (ii) з'єднання триазолу, яке представлене вищезгаданою загальною формулою (I).

[0045] Бажаною є така організація передбаченого цим винаходом агента для боротьби з захворюваннями рослин, щоб масове співвідношення суміші сполуки триазолу та флуксапіроксаду варіювалося в межах від 20:1 до 1:80.

[0046] Бажаною є така організація передбаченого цим винаходом агента для боротьби з захворюваннями рослин, щоб масове співвідношення суміші сполуки триазолу та флуксапіроксаду варіювалося в межах від 2:1 до 1:8.

[0047] Бажаним є використання передбаченого цим винаходом агента для боротьби з захворюваннями рослин для протидії захворюванням пшениці.

[0048] Передбачений цим винаходом спосіб боротьби з захворюваннями рослин включає стадію проведення обробки листя чи проведення обробки відмінних від листя об'єктів з використанням вищезгаданого агента для боротьби з захворюваннями рослин.

[0049] Передбачений цим винаходом продукт для боротьби з захворюваннями рослин окремо містить флуксапіроксад і сполуку триазолу, представлену наведеною вище загальною формулою (I); флуксапіроксад і сполука триазолу є активними інгредієнтами, які перед використанням треба змішати один з одним.

[0050] Наступні приклади описують варіант втілення цього винаходу у додаткових подробицях. Безумовно, цей винахід не обмежується прикладами і, отже, ці приклади можуть

бути модифіковані в деталізованих частинах. Крім того, цей винахід не обмежується описаним вище варіантом втілення і, отже, може бути змінений фахівцем у даній галузі в межах обсягу формули винаходу. Зокрема, варіант втілення, що є похідним від належної комбінації технічних засобів, розкритих в різних варіантах втілення, входить в технічний обсяг цього винаходу. Всі документи, описані в цій специфікації, використовуються в якості посилань.

#### Приклади

[0051] <Приклад 1: синтез (1RS, 2SR, 5SR)-5-(4-хлорбензил)-2-хлорометил-2-метил-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ілметил)циклопентанолу (сполука I-1)>

[0052] В атмосфері аргону 3-(4-хлорбензил)-2-гідрокси-1-метил-2-(1H-1,2,4-триазол-1-ілметил)циклопентилетилефір (1RS, 2RS, 3SR)-р-толуолсульфонові кислоти (0,0245 ммоль) розчиняли у безводному ДМФ (диметилформамід) (0,24 мл). Далі до розчиненого продукту реакції додавали хлорид літію (0,245 ммоль), а тоді отриману суміш перемішували при 100 градусах С протягом півтори години. Потім до реакційної суспензії додавали етилацетат (2 мл), а тоді реакційну суспензію промивали насиченим сольовим розчином. Отриманий органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію і потім концентрували. Концентрований продукт реакції очищали за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі, таким чином, щоб отримати наступну сполуку I-1.

Вихід: 58 %

[0053]  $^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ) дельта: 1,18 (3H, c), 1,46 (2H, м), 1,70 (1H, м), 1,92 (2H, м), 2,35 (2H, м), 3,26 (1H, д,  $J=10,8$  Гц), 3,57 (1H, д,  $J=10,8$  Гц), 4,06 (1H, c), 4,25 (1H, д,  $J=14,2$  Гц), 4,54 (1H, д,  $J=14,2$  Гц), 6,98 (2H, д,  $J=8,4$  Гц), 7,21 (2H, д,  $J=8,4$  Гц), 8,02 (1H, c) і 8,19 (1H, c)

[0054] <Приклад 2: синтез (1RS, 2SR, 5SR)-2-хлорметил-5-(4-фторбензил)-2-метил-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ілметил)циклопентанолу (сполука I-2)>

[0055] Наступну сполуку I-2 отримали шляхом виконання тієї ж процедури, що і в Прикладі 1, але, на відміну від Прикладу 1, використали 3-(4-фторбензил)-2-гідрокси-1-метил-2-(1H-1,2,4-триазол-1-ілметил) циклопентилетилефір (1RS, 2RS, 3SR)-р-толуолсульфонові кислоти, отриманий за допомогою способу, описаного в Патентній літературі 1, та традиційного добре відомого способу.

Вихід: 99,6 %

[0056]  $^1\text{H}$ -ЯМР( $\text{CDCl}_3$ ) дельта: 1,18 (3H, c), 1,41–1,53 (2H, м), 1,65–1,76 (1H, м), 1,89–1,98 (2H, м), 2,28–2,38 (2H, м), 3,26 (1H, д,  $J=10,8$  Гц), 3,57 (1H, д,  $J=10,8$  Гц), 4,05 (1H, c), 4,25 (1H, д,  $J=14,2$  Гц), 4,54 (1H, д,  $J=14,2$  Гц), 6,92 (2H, т,  $J=8,7$  Гц), 7,00 (2H, дд,  $J=8,7, 5,5$  Гц), 8,01 (1H, c) або 8,19 (1H, c)

[0057] <Приклад приготування суміші 1 (змочуваний порошок)>

В цьому прикладі 25 частин сполуки I-1, 25 частин флуksапіроксаду, 5 частин лігнінсульфонату, 3 частини алкілсульфонові кислоти і 42 частини діатоміту подрібнювали і змішували до утворення змочуваного порошку. Застосовували змочуваний порошок, який диспергували у воді.

[0058] <Приклад приготування суміші 2 (пилоподібна композиція)>

В цьому прикладі 3 частини сполуки I-1, 3 частини флуksапіроксаду, 40 частин глини і 54 частини тальку подрібнювали і змішували з утворенням пилоподібної композиції. Використали пилоподібну композицію.

[0059] <Приклад приготування суміші 3 (гранули)>

В цьому прикладі 2,5 частини сполуки I-1, 2,5 частини флуksапіроксаду, 43 частини бентоніту, 45 частин глини і 7 частин лігнінсульфонату рівномірно змішували, замішували з водою, перетворювали в гранули за допомогою екструзійного гранулятора, а потім сушили до утворення гранул.

[0060] <Приклад приготування суміші 4 (концентрат для емульгації)>

В цьому прикладі 5 частин сполуки I-1, 5 частин флуksапіроксаду, 10 частин поліоксиетилена алкіларилового ефіру, 3 частини поліоксиетилена сорбітанмонолаурату і 77 частин ксилолу рівномірно змішували і розчиняли до утворення концентрату для емульгації.

[0061] <Приклад дослідження 1: Дослідження для аналізу ефекту протидії сполуки I-1 і флуksапіроксаду фузаріозу колоса пшениці >

[0062] Сполуку I-1 і флуksапіроксад, який синтезували з використанням способу, описаного в Патентній літературі 2, і традиційного добре відомого способу, змішували у заданому співвідношенні. Аналізували синергічний вплив суміші на фузаріоз колоса пшениці. Готували зрізані колоси, вирізані з рослин пшениці (сорт: NORIN № 61) в фазі цвітіння. Готували хімічну суспензію, яка містила сполуку I-1 і флуksапіроксад, а тоді задану кількість хімічної суспензії розпилювали над зрізаними колосами. Для висушування зрізані колоси далі залишали при кімнатній температурі приблизно на одну годину. Потім суспензію, що містить аскоспори з

*Fusarium graminearum* ( $1 \times 10^5$ /мл) розпилювали над зрізаними колосами і тоді зрізані колоси тримали в камері при 20 градусах С. Через п'ять днів після інокуляції оцінювали важкість захворювання пшениці на фузаріоз колоса з використанням способу, описаного в документі (див. Ban & Suenaga *Euphytica* 113, сторінки 87–99, (2000)). Кожне дослідження проводили в трьох дослідних ділянках, кожна з яких включала три колоси. Теоретичну профілактичну цінність (очікувану профілактичну цінність), отриману у випадку, коли хімічну суспензію розпилювали, розраховували за наступною формулою Колбі на основі (i) профілактичної цінності, отриманої у випадку, коли розпилювали сполуку I-1, і (ii) профілактичної цінності, отриманої у випадку, коли розпилювали флуксапіроксад. У випадку, коли фактична профілактична цінність, отримана у випадку, коли хімічну суспензію розпилювали, була більшою за теоретичну профілактичну цінність, визнавали, що хімічна суспензія демонструвала синергічний ефект. У випадку, коли фактична профілактична цінність дорівнювала теоретичній профілактичній цінності, визнавали, що хімічна суспензія демонструвала ефект додавання. У випадку, коли фактична профілактична цінність була меншою за теоретичну профілактичну цінність, визнавали, що хімічна суспензія демонструвала ефект антагонізму.

[0063] Теоретична профілактична цінність, отримана у випадку, коли розпилювали хімічну суспензію =  $A1 + ((100-A1) \times A2)/100$ ,

[0064] де A1 і A2 представляють (i) профілактичну цінність, отриману у випадку, коли розпилювали сполуку I-1, і (ii) профілактичну цінність, отриману у випадку, коли розпилювали флуксапіроксад.

[0065] В Таблиці 1 показано результат дослідження. Як видно з таблиці 1, фактична профілактична цінність є більшою за теоретичну профілактичну цінність. Сполука I-1 і флуксапіроксад продемонстрували синергічний ефект.

[0066]

Таблиця 1

Сполука I-1 (г/га)	Флуксапіроксад (г/га)	Фактична профілактична цінність	Теоретична профілактична цінність у випадку розпилення суміші сполуки I-1 і флуксапіроксаду
0	0	0	
5	0	13	
10	0	39	
20	0	61	
0	10	3	
5	10	44	16
10	10	44	41
20	10	74	62
0	20	0	
5	20	26	13
10	20	58	39
20	20	88	61
0	40	4	
5	40	42	17
10	40	47	41
20	40	68	62

[0067] <Приклад дослідження 2: Дослідження для аналізу протидії сполуки I-2 і флуксапіроксаду фузаріозу колоса пшениці>

[0068] Синергічний ефект, який продемонстрували на фузаріозі колоса пшениці у випадку, коли суміш сполуки I-2 і флуксапіроксад розпилювали, проаналізували таким же чином, як у Прикладі дослідження 1, за винятком того, що замість сполуки I-1 використовували сполуку I-2.

[0069] В Таблиці 2 показано результат дослідження. Як видно з Таблиці 2, фактична профілактична цінність, яку отримали у випадку, коли суміш сполуки I-2 і флуксапіроксаду фактично розпилювали, є більшою за теоретичну профілактичну цінність, яку розраховували на основі (i) профілактичної цінності, отриманої у випадку, коли розпилювали сполуку I-2, та (ii) профілактичної цінності, отриманої у випадку, коли розпилювали флуксапіроксад. Сполука I-2 і флуксапіроксад продемонстрували синергічний ефект.

[0070]

Таблиця 2

Сполука I-2 (г/га)	Флуксапіроксад (г/га)	Фактична профілактична цінність	Теоретична профілактична цінність у випадку, коли суміш сполуки I-2 і флуксапіроксаду розпилюється
0	0	0	
5	0	34	
10	0	45	
15	0	62	
20	0	78	
0	10	8	
5	10	47	40
10	10	56	49
15	10	69	65
0	20	16	
5	20	49	45
10	20	71	54
15	20	87	69
20	20	91	81
0	30	14	
5	30	55	43
10	30	67	53
15	30	78	68
20	30	82	81
0	40	9	
10	40	65	50
15	40	82	66
20	40	91	80

[0071] <Приклад дослідження 3: Дослідження для аналізу протидії сполуки I-1 і флуксапіроксаду бурій іржі пшениці>

- 5 [0072] Пшеницю (сорт: Мопорол) висівали в полі і отримували рослини пшениці в стадії колосіння. Аналізували ефект протидії бурій іржі пшениці у рослин пшениці, який продемонстрував розпилений хімікат. Хімічні суспензії, кожна з яких містила сполуку I-1 і флуксапіроксад, і хімічні суспензії, що містили відповідні порівняльні хімікати, розводили водою так, щоб інгредієнти хімічних суспензій були в заданій кількості, яку мали використовувати.
- 10 Потім 400 л/га кожної з хімічних суспензій розпилювали над рослинами пшениці. Порівняльними хімікатами були Adexar (назва продукту; виробництво BASF), Opus (назва продукту; виробництво BASF), Proline (назва продукту; виробництво Bayer Crop Science) і Caramba (назва продукту; виробництво BASF). Через 28 днів після розпилення було перевірено факт наявності бурої іржі пшениці.

- 15 [0073] В Таблиці 3 показано результат дослідження. Як видно з Таблиці 3, хімічні суспензії, кожна з яких містила сполуку I-1 і флуксапіроксад, продемонстрували кращий ефект щодо протидії бурій іржі пшениці, ніж хімічні суспензії, що містили відповідні наявні у продажу порівняльні хімікати.

[0074]

Таблиця 3

Хімікати	Кількість, яку потрібно розпилювати (г/га)	Частка області виникнення захворювання через 28 днів після розпилення (%)
Сполука I-1	125	1
Флуксапіроксад	125	
Сполука I-1	90	2
Флуксапіроксад	125	
Сполука I-1	63	2
Флуксапіроксад	125	
Adexar	250	3

Продовження таблиці 3

Хімікати	Кількість, яку потрібно розпилювати (г/га)	Частка області виникнення захворювання через 28 днів після розпилення (%)
Opus	125	9
Proline	200	27
Caramba	90	10
жодного	-	31

[0075] <Приклад дослідження 4: Дослідження для аналізу протидії сполуки I-1 і флуксапіроксаду септоріозу листя пшениці>

[0076] Пшеницю (сорт: Riband) висівали в полі і отримували рослини пшениці в стадії міжвузлового подовження. Розглядали ефект протидії септоріозу листя пшениці у рослин пшениці, продемонстрований розпиленням хімікатом. Хімічні суспензії, кожна з яких містила сполуку I-1 і флуксапіроксад, і хімічні суспензії, що містили відповідні порівняльні хімікати, розводили водою так, щоб інгредієнти хімічних суспензій були в заданій кількості, яку мали використовувати. Потім 400 л/га кожної з хімічних суспензій розпилювали над рослинами пшениці. Порівняльними хімікатами були Adexar (назва продукту; виробництво BASF), Opus (назва продукту; виробництво BASF), Proline (назва продукту; виробництво Bayer Crop Science) і Caramba (назва продукту; виробництво BASF). Через 29 днів після розпилення перевіряли факт наявності септоріозу листя пшениці.

[0077] В Таблиці 4 показано результат дослідження. Як видно з Таблиці 4, хімічні суспензії, кожна з яких містила сполуку I-1 і флуксапіроксад, продемонстрували кращий ефект протидії септоріозу листя пшениці, ніж хімічні суспензії, що містили відповідні наявні у продажу порівняльні хімікати.

[0078]

Таблиця 4

Хімікати	Кількість, яку потрібно розпилювати (г/га)	Частка області виникнення захворювання через 29 днів після розпилення (%)
Сполука I-1	125	1
Флуксапіроксад	125	
Сполука I-1	90	1
Флуксапіроксад	125	
Сполука I-1	63	2
Флуксапіроксад	125	
Adexar	250	3
Opus	125	13
Proline	200	6
Caramba	90	15
жодного	-	38

[0079] <Приклад дослідження 5: Дослідження для аналізу протидії сполуки I-1 і флуксапіроксаду бурій іржі пшениці>

[0080] Насіння пшениці (сорт: NORIN No. 61) висівали в поле восени за 1 (один) рік до розпилення хімікатів; хімікати розпилювали над рослинами пшениці в фазі цвітіння рослин пшениці. Аналізували ефект протидії бурій іржі пшениці у рослин пшениці, продемонстрований розпиленням хімікатом. Зокрема, восени насіння пшениці висівали в полі в два ряди з міжряддям шириною 30 см. (i) Хімічні суспензії, кожна з яких містила сполуку I-1 і флуксапіроксад, (ii) хімічну суспензію, що містила сполуку I-1, та (iii) хімічні суспензії, кожна з яких містила флуксапіроксад, розводили водою так, щоб кожен інгредієнт з хімічних суспензій був у заданій кількості, яку мали використовувати. Кожну з хімічних суспензій далі розпилювали над рослинами пшениці на стадії цвітіння у році. Після розпилення хімічних суспензій, горщик, в якому були висаджені хворі на буру іржу рослини пшениці, встановлювали у кожному дослідному ділянці між двома рядами рослин пшениці так, щоб зумовити зараження рослин пшениці бурою іржею пшениці. Кожне дослідження проводили в трьох дослідних ділянках, кожна з яких мала

розмір 0,5 м х 4 м (2 м<sup>2</sup>). Через 20 днів після розпилення хімічних суспензій досліджували частоту виникнення бурої іржі пшениці у 20 покривних листках, які обирали випадковим чином з однієї з трьох дослідних ділянок. Далі розраховували поширеність захворювання (показник важкості захворювання на буру іржу пшениці). Теоретичну профілактичну цінність (очікувану профілактичну цінність), отриману у випадку, коли розпилювали хімічну суспензію, яка містила сполуку I-1 і флуксапіроксад, розраховували за допомогою вищевказаної формули Колбі (див. Приклад дослідження 1) на основі (i) профілактичної цінності, отриманої у випадку, коли розпилювали лише сполуку I-1, та (ii) профілактичної цінності, отриманої у випадку, коли розпилювали лише флуксапіроксад. У випадку, коли фактична профілактична цінність, отримана у випадку, коли розпилювали хімічну суспензію, яка містила сполуку I-1 і флуксапіроксад, була більшою за теоретичну профілактичну цінність, визнавали, що хімічна суспензія, яка містила сполуку I-1 і флуксапіроксад, демонструвала синергічний ефект. У випадку, коли фактична профілактична цінність дорівнювала теоретичній профілактичній цінності, визнавали, що хімічна суспензія, яка містила сполуку I-1 і флуксапіроксад, демонструвала ефект додавання. У випадку, коли фактична профілактична цінність була меншою за теоретичну профілактичну цінність, визнавали, що хімічна суспензія, яка містила сполуку I-1 і флуксапіроксад, демонструвала ефект антагонізму.

[0081] У Таблиці 5 показано результат, отриманий шляхом розрахунку фактичних профілактичних цінностей на основі відповідних середніх часток області виникнення захворювання покривних листків. У Таблиці 6 показано результат, отриманий шляхом розрахунку фактичних профілактичних цінностей на основі відповідних часток областей виникнення захворювання покривних листків. Як видно з Таблиці 5 і 6, фактичні профілактичні цінності більші за відповідні теоретичні профілактичні цінності. Сполука I-1 і флуксапіроксад продемонстрували синергічний ефект.

[0082]

Таблиця 5

Сполука I-1 (г/га)	Флуксапіроксад (г/га)	Фактична профілактична цінність	Теоретична профілактична цінність у випадку розпилення суміші сполуки I-1 і флуксапіроксаду
0	0	0	
7,5	0	42,6	
0	7,5	29,3	
0	30	80,6	
7,5	7,5	84,9	59,4
7,5	30	94,4	88,9

[0083]

Таблиця 6

Сполука I-1 (г/га)	Флуксапіроксад (г/га)	Фактична профілактична цінність	Теоретична профілактична цінність у випадку розпилення суміші сполуки I-1 і флуксапіроксаду
0	0	0	
7,5	0	16,4	
0	7,5	6,8	
0	30	64,4	
7,5	7,5	65,7	22,0
7,5	30	80,8	70,2

Промислове застосування

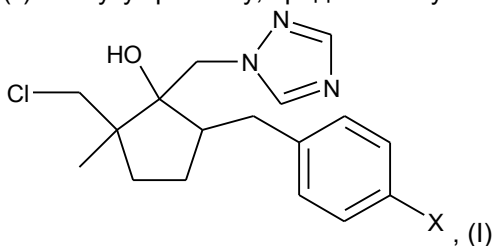
[0084] Цей винахід можна використати в якості агента для боротьби з захворюваннями рослин, що сприяє зменшенню шкідливого впливу на рослини при протидії захворюванням рослин.

## ФОРМУЛА ВІНАХОДУ

1. Агент для боротьби з захворюваннями рослин, що містить як активні інгредієнти:

(i) флуксапіроксад та

(ii) сполуку триазолу, представлену загальною формулою (I)



де X означає атом хлору або атом фтору.

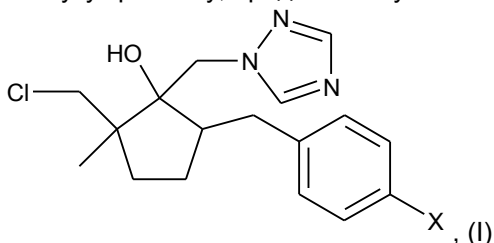
5 2. Агент для боротьби з захворюваннями рослин за п. 1, де співвідношення суміші за масою сполуки триазолу та флуксапіроксаду варіюється в межах від 20:1 до 1:80.

3. Агент для боротьби з захворюваннями рослин за п. 1 або 2, де співвідношення суміші за масою сполуки триазолу та флуксапіроксаду варіюється в межах від 2:1 до 1:8.

10 4. Агент для боротьби з захворюваннями рослин за будь-яким з пп. 1-3, призначений для протидії захворюванням пшениці.

5. Спосіб боротьби з захворюваннями рослин, що включає стадію проведення обробки листя або відмінних від листя об'єктів, використовуючи агент для боротьби з захворюваннями рослин, як зазначено в будь-якому з пп. 1-4.

15 6. Продукт для боротьби з захворюваннями рослин, що окремо містить флуксапіроксад і сполуку триазолу, представлену загальною формулою (I)



де X означає атом хлору або атом фтору;

флуксапіроксад і сполука триазолу є активними інгредієнтами, які перед використанням потребують змішування один з одним.

20

---

Комп'ютерна верстка А. Крижанівський

---

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Василя Липківського, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

---

ДП "Український інститут інтелектуальної власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601