



УКРАЇНА

(19) UA (11) 93524 (13) C2

(51) МПК (2011.01)
A01N 47/24 (2006.01)
A01P 3/00
A01C 1/08 (2006.01)

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ

ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(54) СПОСІБ ІНДУКУВАННЯ СТІЙКОСТІ ЗЕРНОВИХ КУЛЬТУР ДО SEPTORIA Spp. ТА СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ ЗЕРНОВИХ КУЛЬТУР, ЯКІ Є СТІЙКИМИ ДО SEPTORIA Spp.

1

2

(21) a200806369

(22) 17.10.2006

(24) 25.02.2011

(86) PCT/EP2006/067480, 17.10.2006

(31) 10 2005 052 095.2

(32) 28.10.2005

(33) DE

(31) 06118106.1

(32) 28.07.2006

(33) EP

(46) 25.02.2011, Бюл.№ 4, 2011 р.

(72) УОТЕРХАУС СТВ, GB, ШТІРЛЬ РАЙНХАРД,
DE, ШТАММЛЕР ГЕРД, DE

(73) БАСФ SE, DE

(56) UA 73183, C2, 15.06.2005

WO 9701277, A, 16.01.1997

WO 9829537, A, 09.07.1998

WO 03075663, A, 18.09.2003

WO 0182701, A, 08.11.2001

PASQUER F. ET AL. Specific patterns of changes in wheat gene expression after treatment with three antifungal compounds// PLANT MOLECULAR BIOLOGY, vol. 57, no. 5, March 2005, p. 693-707

VENANCIO W.S. ET AL. Physiological effects of strobilurin fungicides on plants// PUBLICATIO UEPG. CIENCIAS EXATAS E DA TERRA, CIENCIAS AGRARIAS E ENGENHARIA, UNIVERSIDADE ESTADUAL DE PONTA GROSSA, EDITORA, PONTA GROSSA, BR, vol. 9, no. 3, December 2003, p. 59-68

HERMS A. ET AL. A Strobilurin Fungicide Enhances the Resistance of Tobacco against Tobacco Mosaic Virus and Pseudomonas syringae pv tabaci// PLANT PHYSIOLOGY, vol. 130, September 2002, p. 120-127

(57) 1. Спосіб індукування стійкості зернових культур до Septoria spp., який включає обробку рослин, ґрунту, у якому рослини виростають або будуть виростати, і/або насіння зернових культур ефективною кількістю стробілуруну або його сільськогосподарсько-прийнятної солі, який інгібує мітохондріальний дихальний ланцюг на рівні b/c₁ комплексу, де стробілурун вибраний із групи, яка включає піраклостробін, крезоксим-метил, димоксистробін, метил-2-(орто-(2,5-

диметилфенілоксиметилен)-феніл)-3-метоксіакрилат, пікоксистробін, трифлоксистробін, енестроурин, оризастробін, метоміностробін, азоксистробін і флуоксастробін.

2. Спосіб за п. 1, де стробілурун вибраний із групи, яка включає азоксистробін, піраклостробін і пікоксистробін.

3. Спосіб за п. 1, де стробілурун являє собою піраклостробін.

4. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, де нанесення стробілуруну або його сільськогосподарсько-прийнятної солі здійснюють протягом перших шести тижнів вегетаційного періоду рослин або такого ж періоду після появи сходів рослин.

5. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, де здійснюють повторне нанесення стробілуруну або його сільськогосподарсько-прийнятної солі.

6. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, де повторне нанесення стробілуруну або його сільськогосподарсько-прийнятної солі здійснюють на кожний 10-20 день.

7. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, де протягом одного сезону здійснюють від двох до десяти нанесень стробілуруну або його сільськогосподарсько-прийнятної солі.

8. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, який здійснюють шляхом позакореневого внесення.

9. Спосіб за будь-яким з пп. 1-8, який здійснюють на пшениці.

10. Спосіб за п. 9, де в рослини індукують толерантність до Septoria tritici.

11. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, де стробілурун або його сільськогосподарсько-прийнятну сіль застосовують разом з додатковою фунгіцидною сполукою.

12. Спосіб одержання зернових культур, які є стійкими до Septoria spp., який включає обробку рослини, ґрунту, у якому рослина виростає або буде виростати, і/або насіння, з якого рослина виростає, ефективною кількістю стробілуруну або його сільськогосподарсько-прийнятної солі, де стробілурун вибраний із групи, яка включає піраклостробін, крезоксим-метил, димоксистробін, метил-2-(орто-(2,5-диметилфенілоксиметилен)-

(13) C2

(11) 93524

(19) UA

феніл)-3-метоксіакрилат, пікоксистробін, трифлористробін, енестробурин, оризастробін, метомі-

ностробін, азоксистробін і флуоксастробін.

Даний винахід стосується способу індукування у рослини толерантності до шкідливих грибів, який включає нанесення на рослину, ґрунт, у якому рослина виростає або буде виростати, і/або насіння рослини ефективної кількості активної сполуки, яка інгібує мітохондріальний дихальний ланцюг на рівні b/c₁ комплексу.

Активні сполуки, застосовувані відповідно до даного винаходу, можуть наноситися на рослини, насіння і/або ґрунт до або після посіву рослин або до або після появи сходів рослин.

Практичний досвід у сільському господарстві показав, що повторне застосування певних активних речовин при боротьбі зі шкідливими грибами в багатьох випадках приводить до швидкої селекції таких штамів грибів, які розвили до активних речовин, які розглядаються, природну або адаптовану стійкість. У такому випадку, ефективна боротьба із цими грибами за допомогою активних речовин, які розглядаються, вже більше неможлива. Ці штами грибів звичайно є також перехресно-стійкими до інших активних речовин з однаковим способом дії. Для боротьби із цими штамами грибів необхідні активні речовини з різними способами дії. Однак, пропозиції на ринку активних речовин з новими способами дії обмежені. Виявлення сполук з новими способами дії є метою, на якій постійно сфокусовані дослідження в агрохімічній галузі. Розробка нових активних речовин, при застосуванні яких не спостерігається перехресної стійкості з відомими активними речовинами, є дорогою та потребує багато часу.

Враховуючи поширеність шкідливих грибів, метою даного винаходу є виявлення ефективного, широко застосовного способу, за допомогою якого рослини розвивали б підвищену стійкість/толерантність до шкідливих грибів. Це дозволило б перешкоджати росту обсягів застосування фунгіцидів у сільському господарстві.

Несподівано встановлено, що рослини, оброблені активною речовиною, яка інгібує мітохондріальний дихальний ланцюг на рівні b/c₁ комплексу, мають підвищену толерантність до шкідливих грибів.

"Індукування толерантності" у рамках даного винаходу означає значне зниження сприйнятливості оброблених рослин до шкідливих грибів, яке можна спостерігати при здійсненні способу відповідно до винаходу. Зазначений ефект у даному документі також називається "індукуванням стійкості" у рослин до відповідних шкідливих грибів.

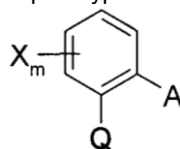
Отже, рослини, які оброблені способом відповідно до даного винаходу, ушкоджуються шкідливими грибами менше, ніж аналогічні рослини, не оброблені зазначеним способом. Зокрема, спосіб відповідно до винаходу переважно призводить до ураження шкідливими грибами, яке менше, принаймні, на 20%, більш краще, принаймні, на 30%, також більш краще, принаймні, на 40%, ще більш краще, принаймні, на 50%, ще більш краще, принаймні, на 60%, ще більш краще, принаймні, на

70%, більш краще, принаймні, на 80%, ніж у відповідній контрольній рослині.

Активні сполуки, які інгібують мітохондріальний дихальний ланцюг на рівні b/c₁ комплексу, відомі як пестициди з літератури, причому більшість із них відомі як фунгіциди і/або інсектициди [див., наприклад, Dechema-Monographien Bd. 129, 27-38, VCH Verlagsgemeinschaft Weinheim 1993; Natural Product Reports 1993, 565-574; Biochem. Soc. Trans. 22, 63S (1993)]. Однак, дотепер немає вказівок, що такі активні сполуки можуть ефективно використовуватися для індукування в рослин стійкості до шкідливих грибів, що, проте, виявлено в рамках даного винаходу.

Надзвичайно важливим класом активних сполук, які інгібують мітохондріальний дихальний ланцюг на рівні b/c₁ комплексу, які придатні для застосування відповідно до даного винаходу, є стробілурини. Стробілурини, у цілому, давно відомі як пестициди та, зокрема, описані як фунгіциди та, у деяких випадках, також як інсектициди і є, наприклад, широко застосовуваними для боротьби з різними патогенними грибами (EP-A 178 826; EP-A 253 213; WO 93/15046; WO 95/18789; WO 95/21153; WO 95/21154; WO 95/24396; WO 96/01256; WO 97/15552; WO 97/27189). Додатковим прикладом активної сполуки, яка інгібує мітохондріальний дихальний ланцюг на рівні b/c₁ комплексу є фамоксадон (5-метил-5-(4-феноксифеніл)-3-(феніламіно)-2,4-оксазоліндіон).

Характерними прикладами стробілуринів, придатних для застосування в даному винаході, є стробілуринові сполуки формули I

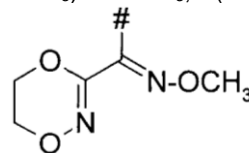


де замісники та індекси мають наступні значення:

X означає галоген, C₁-C₄-алкіл або трифторметил;

m означає 0 або 1;

Q означає C(=CH-CH₃)-COOCH₃, C(=CH-OCH₃)-COOCH₃, C(=N-OCH₃)-CONHCH₃, C(=N-OCH₃)-COOCH₃, N(-OCH₃)-COOCH₃ або групу Q1



де # означає місце приєднання до фенільного кільця;

A означає -O-B, -CH₂O-B, -OCH₂-B, -CH₂S-B, -CH=CH-B, -C≡C-B, -CH₂O-N=C(R¹)-B, -CH₂S-N=C(R¹)-B, -CH₂O-N=C(R¹)-CH=CH-B або -CH₂O-N=C(R¹)-C(R²)=N-OR³, де B приймає наступні значення:

В означає феніл, нафтил, 5- або 6-членний гетероарил або 5- або 6-членний гетероциклі, який включає один, два або три атоми N і/або один атом O або S, або один або два атоми O і/або S, причому ці кільцеві системи є незаміщеними або заміщені однією, двома або трьома однаковими або різними групами R^a :

R^a означає ціано, нітро, аміно, амінокарбоніл, амінотіокарбоніл, галоген, C_1-C_6 -алкіл, C_1-C_6 -галоалкіл, C_1-C_6 -алкілсульфоніл, C_1-C_6 -алкілсульфініл, C_3-C_6 -циклоалкіл, C_3-C_6 -алкокси, C_1-C_6 -галоалкокси, C_1-C_6 -алкілоксикарбоніл, C_1-C_6 -алкілтіо, C_1-C_6 -алкіламіно, ді- C_1-C_6 -алкіламіно, C_1-C_6 -алкіламінокарбоніл, ді- C_1-C_6 -алкіламінокарбоніл, C_1-C_6 -алкіламінотіокарбоніл, ді- C_1-C_6 -алкіламінотіокарбоніл, C_2-C_6 -алкеніл, C_1-C_6 -алкенілокси, феніл, фенокси, бензил, бензилокси, 5- або 6-членний гетероциклі, 5- або 6-членний гетероарил, 5- або 6-членний гетероарилокси, $C(=NOR^a)-R^b$ або $OC(R^a)_2-C(R^b)=NOR^b$,

циклічні радикали, у свою чергу, є незаміщеними або заміщені однією, двома або трьома однаковими або різними групами R^b :

R^b означає ціано, нітро, галоген, аміно, амінокарбоніл, амінотіокарбоніл, C_1-C_6 -алкіл, C_1-C_6 -галоалкіл, C_1-C_6 -алкілсульфоніл, C_1-C_6 -алкілсульфініл, C_3-C_6 -циклоалкіл, C_1-C_6 -алкокси, C_1-C_6 -галоалкокси, C_1-C_6 -алкоксикарбоніл, C_1-C_6 -алкілтіо, C_1-C_6 -алкіламіно, ді- C_1-C_6 -алкіламіно, C_1-C_6 -алкіламінокарбоніл, ді- C_1-C_6 -алкіламінокарбоніл, C_1-C_6 -алкіламінотіокарбоніл, ді- C_1-C_6 -алкіламінотіокарбоніл, C_2-C_6 -алкеніл, C_2-C_6 -алкенілокси, C_3-C_6 -циклоалкіл, C_3-C_6 -циклоалкеніл, феніл, фенокси, фенілтіо, бензил, бензилокси, 5- або 6-членний гетероциклі, 5- або 6-членний гетероарил, 5- або 6-членний гетероарилокси або $C(=NOR^A)-R^B$; де

R^A, R^B означають водень або C_1-C_6 -алкіл;

R^1 означає водень, ціано, C_1-C_4 -алкіл, C_1-C_4 -галоалкіл, C_3-C_6 -циклоалкіл, C_1-C_4 -алкокси або C_1-C_4 -алкілтіо;

R^2 означає феніл, фенілкарбоніл, фенілсульфоніл, 5- або 6-членний гетероарил, 5- або 6-членний гетероарилкарбоніл або 5- або 6-членний гетероарилсульфоніл, причому ці кільцеві системи є незаміщеними або заміщені одним, двома або трьома однаковими або різними радикалами R^a ,

C_1-C_{10} -алкіл, C_3-C_6 -циклоалкіл, C_2-C_{10} -алкеніл, C_2-C_{10} -алкініл, C_1-C_{10} -алкілкарбоніл, C_2-C_{10} -алкенілкарбоніл, C_3-C_{10} -алкінілкарбоніл, C_1-C_{10} -алкілсульфоніл або $C(=NOR^A)-R^B$, причому вуглеводневі радикали цих груп є незаміщеними або заміщені одним, двома або трьома однаковими або різними радикалами R^c :

R^c означає ціано, нітро, аміно, амінокарбоніл, амінотіокарбоніл, галоген, C_1-C_6 -алкіл, C_1-C_6 -галоалкіл, C_1-C_6 -алкілсульфоніл, C_1-C_6 -алкілсульфініл, C_1-C_6 -алкокси, C_1-C_6 -галоалкокси, C_1-C_6 -алкоксикарбоніл, C_1-C_6 -алкілтіо, C_1-C_6 -алкіламіно, ді- C_1-C_6 -алкіламіно, C_1-C_6 -алкіламінокарбоніл, ді- C_1-C_6 -алкіламінокарбоніл, C_1-C_6 -алкіламінотіокарбоніл, ді- C_1-C_6 -алкіламінотіокарбоніл, C_2-C_6 -алкеніл, C_2-C_6 -алкенілокси,

C_3-C_6 -циклоалкіл, C_3-C_6 -циклоалкілокси, 5- або 6-членний гетероциклі, 5- або 6-членний гетероциклілокси, бензил, бензилокси, феніл, фенокси, фенілтіо, 5- або 6-членний гетероарил, 5- або 6-членний гетероарилокси та гетероарилтіо, причому циклічні групи, у свою чергу, можуть бути частково або повністю галогенованими і/або мати один, два або три приєднаних до них однакових або різних радикали R^a ; і

R^3 означає водень, C_1-C_6 -алкіл, C_2-C_6 -алкеніл, C_2-C_6 -алкініл, причому вуглеводневі радикали цих груп є незаміщеними або заміщені одним, двома або трьома однаковими або різними радикалами R^c ; або їх сільськогосподарсько-прийнятні солі; та

стробілуринові сполуки, вибрані із групи, яка включає метил-(2-хлор-5-[1-(3-метилбензилоксиіміно)етил]бензил)карбамат і метил-(2-хлор-5-[1-(6-метилпіридин-2-ілметоксиіміно)етил]бензил)карбамат і їх сільськогосподарсько-прийнятні солі.

Відповідно до даного винаходу, сільськогосподарсько-прийнятні солі включають, зокрема, солі тих катіонів або солі приєднання тих кислот, катіони й аніони яких, відповідно, не здійснюють несприятливого впливу на дію сполук, застосовуваних відповідно до винаходу.

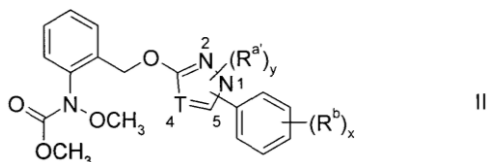
Таким чином, придатними катіонами є, зокрема, іони лужних металів, переважно натрію та калію, лужноземельних металів, переважно кальцію, магнію та барію, і перехідних металів, переважно марганцю, міді, цинку й заліза, а також іони амонію, який, при бажанні, може нести від одного до чотирьох (C_1-C_4)-алкільних замісників і/або один фенільний або бензильний замісник, переважно іони діізопропіламонію, тетраметиламонію, тетрабутиламонію, триметилбензиламонію, а також іони фосфонію, іони сульфонію, переважно три(C_1-C_4 -алкіл)сульфонію, і іони сульфоксонію, переважно три(C_1-C_4 -алкіл)сульфоксонію.

Аніонами солей приєднання кислоти, які можуть з успіхом використовуватися, є, наприклад, хлорид, бромід, фторид, гідросульфат, сульфат, первинний кислий фосфат, вторинний кислий фосфат, нітрат, гідрокарбонат, карбонат, гексафторсилікат, гексафторфосфат, бензоат, а також аніони (C_1-C_4)-алканових кислот, переважно формиат, ацетат, пропіонат і бутират. Такі солі можуть бути одержані шляхом реакції сполуки, застосовуваної відповідно до винаходу, з кислотою придатного аніона, переважно соляною кислотою, бромистоводневою кислотою, сірчаною кислотою, ортофосфорною кислотою або азотною кислотою. Надзвичайно кращими відповідно до даного винаходу є стробілурини, вибрані з азоксистробіну, димоксистробіну, енестробіну, флуоксистробіну, креноксим-метилу, метоміностробіну, пікоксистробіну, піраклостробіну, трифлуксистробіну, оризастробіну, метил-(2-хлор-5-[1-(3-метилбензилоксиіміно)етил]бензил)карбамату, метил-(2-хлор-5-[1-(6-метилпіридин-2-ілметоксиіміно)етил]бензил)карбамату та метил-(2-(орто-(2,5-диметилфенілоксиметил)феніл)-3-метоксиакрилату. Відповідно до даного винаходу, із числа вищевказаних сполук може мати перевагу використання стробілуринів, вибраних з азоксистробіну, димоксистробіну, енестробіну, флуокса-

стробіну, крезоксим-метилу, метоміностробіну, пікоксистробіну, піраклостробіну, трифлуксистробіну й оризастробіну.

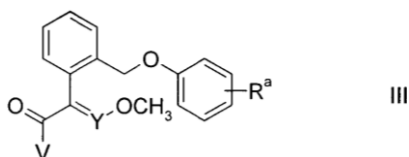
Також надзвичайно придатними для застосування відповідно до винаходу є, зокрема, сполуки, які перераховані в таблицях нижче.

Таблиця I



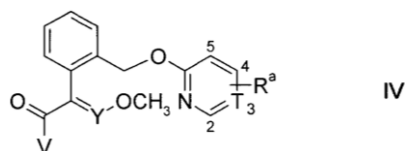
№	T	(R ^a) _y	Положення групи феніл-(R ^b) _x	(R ^b) _x	Посилання
I-1	N	-	1	2,4-Cl ₂	WO 96/01256
I-2	N	-	1	4-Cl	WO 96/01256
I-3	CH	-	1	2-Cl	WO 96/01256
I-4	CH	-	1	3-Cl	WO 96/01256
I-5	CH	-	1	4-Cl	WO 96/01256
I-6	CH	-	1	4-CH ₃	WO 96/01256
I-7	CH	-	1	H	WO 96/01256
I-8	CH	-	1	3-CH ₃	WO 96/01256
I-9	CH	5-CH ₃	1	3-CF ₃	WO 96/01256
I-10	CH	1-CH ₃	5	3-CF ₃	WO 99/33812
I-11	CH	1-CH ₃	5	4-Cl	WO 99/33812
I-12	CH	1-CH ₃	5	-	WO 99/33812

Таблиця II



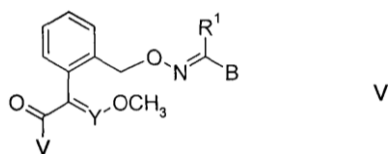
№	V	Y	R ^a	Посилання
II-1	OCH ₃	N	2-CH ₃	EP-A 253 213
II-2	OCH ₃	N	2,5-(CH ₃) ₂	EP-A 253 213
II-3	NHCH ₃	N	2,5-(CH ₃) ₂	EP-A 477 631
II-4	NHCH ₃	N	2-Cl	EP-A 398 692
II-5	NHCH ₃	N	2-CH ₃	EP-A 398 692
II-6	NHCH ₃	N	2-CH ₃ , 4-OCF ₃	EP-A 628 540
II-7	NHCH ₃	N	2-Cl, 4-OCF ₃	EP-A 628 540
II-8	NHCH ₃	N	2-CH ₃ , 4-OCH(CH ₃)-C(CH ₃)=NOCH ₃	EP-A 11 18 609
II-9	NHCH ₃	N	2-Cl, 4-OCH(CH ₃)-C(CH ₃)=NOCH ₃	EP-A 11 18 609
II-10	NHCH ₃	N	2-CH ₃ , 4-OCH(CH ₃)-C(CH ₂ CH ₃)=MOCH ₃	EP-A 11 18 609
II-11	OCH ₃	CH	2,5-(CH ₃) ₂	EP-A 226 917

Таблиця III



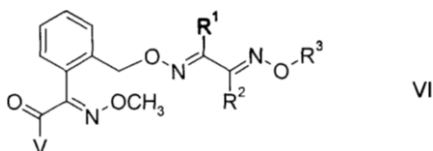
№	V	Y	T	R ^a	Посилання
III-1	OCH ₃	CH	N	2-OCH ₃ , 4-CF ₃	WO 96/16047
III-2	OCH ₃	CH	N	2-OCH(CH ₃) ₂ , 4-CF ₃	WO 96/16047
III-3	OCH ₃	CH	CH	2-CF ₃	EP-A 278 595
III-4	OCH ₃	CH	CH	4-CF ₃	EP-A 278 595
III-5	NHCH ₃	N	CH	2-Cl	EP-A 398 692
III-6	NHCH ₃	N	CH	2-CF ₃	EP-A 398 692
III-7	NHCH ₃	N	CH	2-CF ₃ , 4-Cl	EP-A 398 692
III-8	NHCH ₃	N	CH	2-Cl, 4-CF ₃	EP-A 398 692

Таблица IV



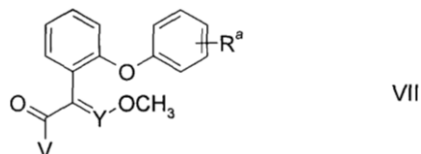
№	V	Y	R ¹	B	Посилання
IV-1	OCH ₃	CH	CH ₃	(3-CF ₃)C ₆ H ₄	EP-A 370 629
IV-2	OCH ₃	CH	CH ₃	(3,5-Cl ₂)C ₆ H ₃	EP-A 370 629
IV-3	NHCH ₃	N	CH ₃	(3-CF ₃)C ₆ H ₄	WO 92/13830
IV-4	NHCH ₃	N	CH ₃	(3-OCF ₃)C ₆ H ₄	WO 92/13830
IV-5	OCH ₃	N	CH ₃	(3-OCF ₃)C ₆ H ₄	EP-A 460 575
IV-6	OCH ₃	N	CH ₃	(3-CF ₃)C ₆ H ₄	EP-A 460 575
IV-7	OCH ₃	N	CH ₃	(3,4-Cl ₂)C ₆ H ₃	EP-A 460 575
IV-8	OCH ₃	N	CH ₃	(3,5-Cl ₂)C ₆ H ₃	EP-A 463 488
IV-9	OCH ₃	CH	CH ₃	CH=CH-(4-Cl)C ₆ H ₄	EP-A 936 213

Таблица V



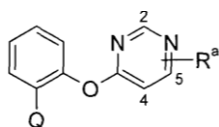
№	V	R ¹	R ²	R ³	Посилання
V-1	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	WO 95/18789
V-2	OCH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	WO 95/18789
V-3	OCH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	WO 95/18789
V-4	NHCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	WO 95/18789
V-5	NHCH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄	CH ₃	WO 95/18789
V-6	NHCH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	WO 95/18789
V-7	NHCH ₃	CH ₃	2,4-C ₆ H ₃	CH ₃	WO 95/18789
V-8	NHCH ₃	Cl	4-F-C ₆ H ₄	CH ₃	WO 98/38857
V-9	NHCH ₃	Cl	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₃	WO 98/38857
V-10	NHCH ₃	CH ₃	CH ₂ C(=CH ₂)CH ₃	CH ₃	WO 97/05103
V-11	NHCH ₃	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃	WO 97/05103
V-12	NHCH ₃	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	WO 97/05103
V-13	NHCH ₃	CH ₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₃	WO 97/05103
V-14	NHCH ₃	CH ₃	O-CH(CH ₃) ₂	CH ₃	WO 97/06133
V-15	NHCH ₃	CH ₃	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	WO 97/06133
V-16	NHCH ₃	CH ₃	C(CH ₃)=NOCH ₃	CH ₃	WO 97/15552

Таблица VI



№	V	Y	R ^a	Посилання
VI-1	NHCH ₃	N	H	EP-A 398 692
VI-2	NHCH ₃	N	3-CH ₃	EP-A 398 692
VI-3	NHCH ₃	N	2-NO ₂	EP-A 398 692
VI-4	NHCH ₃	N	4-NO ₂	EP-A 398 692
VI-5	NHCH ₃	N	4-Cl	EP-A 398 692
VI-6	NHCH ₃	N	4-Br	EP-A 398 692

Таблиця VII



VIII

№	Q	R ^a	Посилання
VII-1	C(=CH-OCH ₃)COOCH ₃	5-O-(2-CN-C ₆ H ₄)	EP-A 382 375
VII-2	C(=CH-OCH ₃)COOCH ₃	5-O-(2-Cl-C ₆ H ₄)	EP-A 382 375
VII-3	C(=CH-OCH ₃)COOCH ₃	5-O-(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)	EP-A 382 375
VII-4	C(=N-OCH ₃)CONHCH ₃	5-O-(2-Cl-C ₆ H ₄)	GB-A 2253624
VII-5	C(=N-OCH ₃)CONHCH ₃	5-O-(2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	GB-A 2253624
VII-6	C(=N-OCH ₃)CONHCH ₃	5-O-(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)	GB-A 2253624
VII-7	C(=N-OCH ₃)CONHCH ₃	5-O-(2-CH ₃ ,3-Cl-C ₆ H ₃)	GB-A 2253624
VII-8	C(=N-OCH ₃)CONHCH ₃	4-F, 5-O-(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)	WO 98/21189
VII-9	C(=N-OCH ₃)CONHCH ₃	4-F, 5-O-(2-Cl-C ₆ H ₄)	WO 98/21189
VII-10	C(=N-OCH ₃)CONHCH ₃	4-F, 5-O-(2-CH ₃ ,3-Cl-C ₆ H ₃)	WO 98/21189
VII-11	Q1	4-F, 5-O-(2-Cl-C ₆ H ₄)	WO 97/27189
VII-12	Q1	4-F, 5-O-(2-CH ₃ ,3-Cl-C ₆ H ₃)	WO 97/27189
VII-13	Q1	4-F, 5-O-(2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	WO 97/27189

Також надзвичайно кращими для застосування відповідно до винаходу є наявні у продажу активні стробілуринові сполуки. Особливу перевагу віддають наступним активним сполукам з таблиць, наведених вище: сполука I-5 (піраклостробін), II-1 (крезоксим-метил), II-3 (димоксистробін), II-11 (ZJ 0712), III-3 (пікоксистробін), IV-6 (трифлуксистробін), IV-9 (енестробурин), V-16 (оризастробін), VI-1 (метоміностробін), VII-1 (азоксистробін) і VII-11 (флуоксастробін). Більше того, придатними сполуками формули I також є флуакрипірім (метил-(E)-2-{α-[2-ізопропокси-6-(трифторметил)піримідин-4-ілокси]-о-толіл}-3-метоксиакрилат).

Спосіб відповідно до даного винаходу надзвичайно придатний для індукування толерантності до шкідливих грибів, наведених нижче:

- види *Alternaria* на овочевих видах, олійному рапсі, цукровому буряку та фруктових, та рисі, такі як, наприклад, *A. solani* або *A. alternata* на картоплі та помідорах;

- види *Aphanomyces* на цукровому буряку й овочевих видах; види *Ascochyta* на зернових і овочевих видах;

- види *Bipolaris* і *Drechslera* на кукурудзі, зернових, рисі та газонних травах, такі як, наприклад, *D. maydis* на кукурудзі;

- *Blumeria graminis* (справжня борошниста роса) на зернових;

- *Botrytis cinerea* (сіра гниль) на суниці, овочевих видах, квітах і виноградних лозах;

- *Bremia lactucae* на салаті-латуку;

- види *Cercospora* на кукурудзі, соєвих бобах, рисі та цукровому буряку;

- види *Cochliobolus* на кукурудзі, зернових, рисі, такі як, наприклад, *Cochliobolus sativus* на зернових, *Cochliobolus miyabeanus* на рисі;

- види *Colletotricum* на соєвих бобах і бавовні;

- види *Drechslera*, *Pyrenophora* на кукурудзі, зернових, рисі та газонних травах, такі як, наприклад, *D. teres* на ячмені або *D. tritici-repentis* на пшениці;

- *Elsinoe ampelina* на виноградних лозах;

- Еска на виноградних лозах, що викликається *Phaeoacremonium chlamydosporium*, *Ph. Aleophilum* і *Formitipora punctata* (син. *Phellinus punctatus*);

- види *Exserohilum* на кукурудзі;

- *Erysiphe cichoracearum* і *Sphaerotheca fuliginea* на огірках;

- види *Fusarium* і *Verticillium* на різних рослинах, такі як, наприклад, *F. graminearum* або *F. culmorum* на зернових або *F. oxysporum* на численних рослинах, таких як, наприклад, помідори;

- *Gaeumannomyces graminis* на зернових;

- види *Gibberella* на зернових та рисі (наприклад, *Gibberella fujikuroi* на рисі);

- *Glomerella cingulata* на виноградних лозах;

- Grainstaining complex на рисі;

- види *Helminthosporium* на кукурудзі та рисі;

- *Isariopsis clavispora* на виноградних лозах;

- *Microdochium nivale* на зернових;

- види *Mycosphaerella* на зернових, бананах і земляному горі, такі як, наприклад, *M. graminicola* на пшениці або *M. fijiensis* на бананах;

- види *Peronospora* на кочанній капусті та цибулинних рослинах, такі як, наприклад, *P. brassicae* на кочанній капусті або *P. destructor* на цибулі;

- *Phakopsara pachyrhizi* та *Phakopsara meibomia* на соєвих бобах; види *Phomopsis* на соєвих бобах і соняшнику;

- *Phomopsis viticola* на виноградних лозах;

- *Phytophthora infestans* на картоплі та помідорах;

- види *Phytophthora* на різних рослинах, такі як, наприклад, *P. capsici* на болгарському перці;

- *Plasmopara viticola* на виноградних лозах;

- *Podosphaera leucotricha* на яблуках;

- *Pseudocercospora herpotrichoides* на зернових;

- види *Pseudoperonospora* на різних рослинах, такі як, наприклад, *P. cubensis* на огірках або *P. humilis* на хмелі;

- *Pseudopezizicola tracheiphilae* на виноградних лозах;

- види *Puccinia* на різних рослинах, такі як, наприклад, *P. tritricina*, *P. striiformis*, *P. hordei* або *P. graminis* на зернових або *P. asparagi* на спаржі;

- *Pyricularia oryzae*, *Corticium sasakii*, *Sarocladium oryzae*, *S. attenuatum*, *Entyloma oryzae* на рисі;

- *Pyricularia grisea* на газонних травах і зернових;

- види *Pythium* на газонних травах, рисі, кукурудзі, бавовні, олійному рапсі, соняшнику, цукровому буряку, овочевих культурах і інших рослинах, такі як, наприклад, *P. ultimum* на різних рослинах, *P. aphanidermatum* на газонних травах;

- *Guignardia budwelli* на виноградних лозах;

- види *Rhizoctonia* на бавовні, рисі, картоплі, газонних травах, кукурудзі, олійному рапсі, картоплі, цукровому буряку, овочевих культурах і на різних рослинах, такі як, наприклад, *R. solani* на буряку та різних рослинах;

- *Rhynchosporium secalis* на ячмені, житі та тритикалі;

- види *Sclerotinia* на олійному рапсі та соняшнику;

- *Septoria tritici* та *Stagonospora nodorum* на пшениці;

- *Erysiphe* (син. *Uncinula*) *pecator* на виноградних лозах; види *Setosphaeria* на кукурудзі та газонних травах;

- *Sphacelotheca reilina* на кукурудзі;

- види *Thievaliopsis* на соєвих бобах і бавовні;

- види *Tilletia* на зернових;

- види *Ustilago* на зернових, кукурудзі та цукровій тростині, такі як, наприклад, *U. maydis* на кукурудзі;

- види *Venturia* (парша) на яблуках і грушах, такі як, наприклад, *V. inaequalis* на яблуках.

Спосіб відповідно до винаходу переважно також придатний для боротьби зі штамами шкідливих грибів, які мають підвищену толерантність до активних речовин стробілуринового типу, зокрема, для боротьби з видами *Septoria*, такими як *Septoria tritici*.

Спосіб здійснюється шляхом обробки рослини, ґрунту і/або насіння рослин ефективною кількістю активної сполуки, застосовуваної відповідно до даного винаходу, зокрема сполуки формули I. Нанесення може бути здійснене як до (захисне індукування толерантності до ураження грибами), так і після (індукування толерантності з метою обмеження росту грибів і пов'язаної із цим нанесення шкоди рослині від майбутнього ураження грибами) зараження рослини, фунту і/або насіння рослини грибами.

У кращому варіанті способу відповідно до винаходу, активна речовина, застосовувана відповідно до даного винаходу, зокрема, сполука формули I, наноситься для захисту рослини, що приводить до збільшеної толерантності відповідної рослини до ураження шкідливими грибами.

У наступному кращому варіанті способу відповідно до винаходу, обробку рослин активною речовиною, зокрема, сполукою формули I, здійснюють протягом перших шести тижнів, зокрема, протягом перших чотирьох тижнів вегетаційного періоду рослин або такого ж періоду після появи сходів рослин, головним чином, до першого захис-

ного нанесення фунгіцидів. Може бути надзвичайно кращим здійснювати перше нанесення протягом перших шести, зокрема, протягом перших чотирьох тижнів вегетаційного періоду рослини, який необхідно надати стійкості до ураження грибами.

Відповідно до даного винаходу, звичайно бажано обробляти рослини до їх ураження, зокрема, більш ніж за один тиждень до їх ураження шкідливими грибами. Протягом цього часу здійснюють від однієї до десяти обробок активною речовиною, зокрема, сполукою формули I. При цьому можна спостерігати значне зменшення сприйнятливості рослини до шкідливих грибів.

У випадку овочевих і польових культур, таких як соєві боби, бавовна, тютюн, квасоля, горох і зернових, таких як маїс, пшениця, ячмінь, може бути кращим здійснювати нанесення активної речовини незабаром після появи сходів рослини, переважно протягом перших чотирьох тижнів після появи сходів або здійснення обробки насіння. Переважно обробляти рослини від двох до п'яти разів, зокрема, від двох до трьох разів.

У випадку фруктових і інших багаторічних рослин, обробку переважно здійснюють протягом перших шести, переважно перших чотирьох тижнів вегетаційного періоду. Переважно проводити від двох до п'яти обробок.

Також кращим відповідно до винаходу може бути здійснення повторного нанесення активної сполуки, застосовуваної відповідно до даного винаходу, зокрема, сполуки формули I. Загалом, найкращий результат можна спостерігати, коли обробку повторюють кожний 10-20 день.

У відповідності з наступним кращим варіантом винаходу, протягом одного сезону здійснюють від двох до десяти нанесень активної сполуки, застосовуваної відповідно до даного винаходу, зокрема, сполуки формули I.

Відповідно до даного винаходу, перше нанесення переважно здійснюють до початку вегетаційного періоду, що може бути, зокрема, корисно, якщо спосіб відповідно до винаходу здійснюють на овочевих або польових культурах, таких як, наприклад, озима пшениця.

Відповідно до одного варіанта даного винаходу, спосіб відповідно до винаходу переважно здійснюють шляхом позакореневого внесення. Це може бути надзвичайно кращим у випадку польових і овочевих культур, таких як картопля, томати, огірки, цибуля і салат-латук. Може бути кращим здійснювати аж до 10 обробок.

Відповідно до одного варіанта винаходу, спосіб відповідно до винаходу здійснюють на овочевих або польових культурах. У цьому варіанті, зокрема, здійснюють від понад двох і аж до десяти нанесень активної сполуки, застосовуваної відповідно до даного винаходу, зокрема, сполуки формули I.

Відповідно до ще одного варіанта винаходу, спосіб відповідно до винаходу здійснюють на соєвих бобах, маїсі (кукурудзі), бавовні, тютюні, квасолі, пшениці, житі та горосі.

Відповідно до ще одного варіанта винаходу, спосіб відповідно до винаходу здійснюють на зернових, зокрема, на пшениці.

Відповідно до ще одного варіанта, за допомогою способу відповідно до винаходу у рослини, переважно у пшениці, індують толерантність до *Septoria* spp. Більш конкретно, у такий спосіб індують толерантність до *Septoria tritici*.

Відповідно до іншого варіанта винаходу, спосіб індування толерантності здійснюють на багаторічних рослинах. Одним характерним прикладом цього варіанта є здійснення способу відповідно до винаходу на виноградних лозах.

Відповідно до ще одного варіанта, у рослин, зокрема у виноградних лоз, за допомогою способу відповідно до винаходу індують стійкість до *Botrytis cinerea*, *Plasmopara viticola*, *Erysiphe necator* і/або ески. Більш конкретно, у такий спосіб індують стійкість до ески.

Еска являє собою комплексну хворобу, що викликається різними патогенними грибами. Патогенами, які можуть бути пов'язані із симптомами ески відповідно до літератури є *Fomitiporia punctata* (син. *Phellinus punctatus*), *Fomitiporia mediterranea*, *Phaeroacremonium* spp.: *Phaeroacremonium aleophilum* і *Phaemoniella chlamydosporum*. Виноградна лоза може бути уражена одним, декількома або навіть усіма патогенами, які можуть бути пов'язані з ескою. Одним індивідуальним грибом, який був ізольований з деревини уражених ескою виноградних лоз, є *Phaemoniella chlamydosporum* (гриб білої гнилі). Відомі гостра та хронічна форми розвитку ески, які можуть приводити до різних симптомів. Симптомами хронічної форми ески є, наприклад, знебарвлення плями на листках і темні плями на ягодах. Більш того, деревина внутрішньої частини більш старих виноградних лоз часто видозмінюється у м'яку та пухку речовину. Виноградна лоза, яка страждає від гострої форми ески, швидко рубцюється та, в остаточному підсумку, сохне та відмирає. Несподівано встановлено, що застосування способу відповідно до винаходу дозволяє надати виноградним лозам толерантності до ески, таким чином, являє собою ефективний шлях запобігання зараження ескою виноградної лози.

Відповідно до ще одного варіанта, за допомогою способу відповідно до винаходу в рослин, зокрема у виноградних лоз, індують стійкість до *Plasmopara viticola*, *Uncinula necator*, *Guignardia bidwelli*, *Pseudopezicula tracheiphila*, *Phomopsis viticola*, *Elsinoe ampelina*, *Glomerella cingulata*, *Isariopsis clavispora* і/або *Botrytis cinerea*.

Крім того, відповідно до іншого варіанта винаходу, активну сполуку, зокрема, сполуку формули I або відповідну суміш або препарат, який містить цю сполуку, наносять на рослини і/або насіння рослин протягом перших шести тижнів вегетаційного періоду рослини або такого ж періоду після проростання насіння. Залежно від серйозності зараження та характеру бажаного ефекту, норми внесення активної речовини знаходяться у діапазоні між 1 і 1000 г, краще між 20 і 750 г, активної речовини на гектар.

Композиції включають активну речовину, зокрема, сполуку формули I, звичайно в діапазоні між 0.1 і 95, краще між 0.5 і 90 мас. %.

Звичайно, норми внесення знаходяться у діапазоні між 0.01 і 2.0 кг активної речовини на гектар, залежно від характеру бажаного ефекту.

У випадку обробки насіння, наприклад шляхом обпилювання, покриття або просочування насіння, активної речовини звичайно необхідно від 1 до 1000 г/100 кг, краще від 5 до 100 г/100 кг насіння.

Активні сполуки, застосовувані відповідно до винаходу, зокрема, сполуки формули I, можуть бути переведені у звичайні препарати, наприклад розчини, емульсії, суспензії, дуети, порошки, пасту та грануляти. Форма застосування залежить від мети застосування; у кожному випадку повинен бути забезпечений максимально тонкий та рівномірний розподіл сполук відповідно до винаходу.

Препарати приготують відомим способом, наприклад, шляхом змішування активних сполук з розчинниками і/або носіями, при необхідності із застосуванням емульгаторів і диспергаторів.

Придатними розчинниками/допоміжними засобами є головним чином:

- вода, ароматичні розчинники (наприклад, продукти Solvesso, ксилол), парафіни (наприклад, фракції сирої нафти), спирти (наприклад, метанол, бутанол, пентанол, бензиловий спирт), кетони (наприклад, циклогексанон, гамма-бутиролактон), піролідони (N-метилпіролідон, N-октилпіролідон), ацетати (глікольдіацетат), гліколі, диметиламідні кислот жирного ряду, кислоти жирного ряду та складні ефіри кислот жирного ряду. В принципі, можуть також застосовуватися й суміші розчинників;

- носії, такі, як природні мінерали (наприклад, каоліни, глини, тальк, крейда) і синтетичні мінерали (наприклад, високодисперсний кремнезем, силікати); емульгатори, такі, як неіонні й аніонні емульгатори (наприклад, поліоксіетиленові ефіри спиртів жирного ряду, алкілсульфонати й арилсульфонати) і диспергатори, такі, як лігнінсульфітні відпрацьовані луги та метилцелюлоза.

Придатними поверхнево-активними речовинами є солі лужних, лужноземельних металів, амонію та лігносульфокислоти, нафталінсульфокислоти, фенолсульфокислоти, дибутілнафталінсульфокислоти, алкіларилсульфонати, алкілсульфати, алкілсульфонати, сульфати спиртів жирного ряду, гліколеві ефіри кислот жирного ряду та сульфатованих спиртів жирного ряду, далі продукти конденсації сульфонових нафталіну та похідних нафталіну з формальдегідом, продукти конденсації нафталіну або нафталінсульфокислоти з фенолом і формальдегідом, поліоксіетиленоктилфеноловий ефір, етоксирований ізооктилфенол, октилфенол, нонілфенол, алкілфенолполігліколеві ефіри, трибутилфенілполігліколевий ефір, тристирилфенілполігліколевий ефір, алкіларилполіефірні спирти, конденсати спирту та спирту жирного ряду з етиленоксидом, етоксирована рицинова олія, поліоксіетиленалкілові ефіри, етоксирований поліоксипропілен, полігліколевий ацеталь лаурилового спирту, складні ефіри сорбіту, лігнінсульфітні відпрацьовані луги та метилцелюлоза.

Для одержання призначених для безпосереднього розбризкування розчинів, емульсій, паст або масляних дисперсій, придатні фракції нафти із середньою - високою точкою кипіння, такі як гас

або дизельне паливо, далі кам'яновугільні масла, а також масла (олії) рослинного або тваринного походження, аліфатичні, циклічні або ароматичні вуглеводні, наприклад, толуол, ксилол, парафін, тетрагідронафталін, алкіловані нафталіни або їх похідні, метанол, етанол, пропанол, бутанол, циклогексанол, циклогексанон, ізофорон, сильнополярні розчинники, наприклад, диметилсульфоксид, N-метилпіролідон або вода.

Порошки, матеріали для розкидання та обпилювання можуть бути приготовлені шляхом змішування або супутнього розмелу активних речовин із твердим носієм.

Гранулят, наприклад покритий, просочений і гомогенний, можна одержати за допомогою сполучення активних інгредієнтів із твердими носіями. Прикладами твердих носіїв є мінеральні землі, такі, як силікагель, силікати, тальк, каолін, атаклей, вапняк, вапно, крейда, болюс, лес, глина, доломіт, діатомова земля, сульфат кальцію, сульфат магнію, оксид магнію, розмелені пластмаси, добрива, такі як, наприклад, сульфат амонію, фосфат амонію, нітрат амонію, сечовини та продукти рослинного походження, такі як борошно зернових культур, борошно деревної кори, деревне борошно та борошно горіхової шкарлупи, целюлозний порошок та інші тверді носії.

Препарати для обробки насіння можуть додатково містити сполучні і/або желувальні речовини та, при необхідності, барвники.

Сполучні речовини можуть додаватися для поліпшення адгезії активних речовин до насіння після обробки. Прикладами придатних сполучних речовин є блокспівполімерні ЕО/ПО поверхнево-активні речовини, але також і полівінілспирти, полівінілпіролідони, поліакрилати, поліметакрилати, полібутени, поліізобутилені, полістироли, поліетиленаміни, поліетиленаміди, поліетиленіміни (Lupasol[®], Polymim[®]), поліефіри, поліуретани, полівінілацетати, тилоза та співполімери, похідні з вищевказаних полімерів. Придатною желувальною речовиною є, наприклад, карагенан (Satiagel[®]).

Загалом, препарати включають від 0.01 до 95 мас.%, краще, від 0.1 до 90 мас.%, активної речовини. У зв'язку із цим, активні речовини використовуються із чистотою від 90% до 100%, краще від 95% до 100% (відповідно до ЯМР спектра).

Концентрації активних речовин у готових до вживання препаратах можуть варіюватися в широкому діапазоні. Загалом, вони знаходяться у діапазоні між 0.0001 і 10%, краще між 0.01 і 1%.

Активні сполуки з великим успіхом можуть застосовуватися також відповідно так названого ультрамалооб'ємного способу (ULV), який дозволяє застосування препаратів з більш ніж 95% мас. активної речовини або активної речовини без добавок.

Для обробки насіння, розглянуті препарати розбавляють у два-десять разів, одержуючи концентрацію активних речовин у готових до вживання препаратах у діапазоні від 0.01 до 60 мас.%, краще від 0.1 до 40 мас.%.
Далі наведені приклади препаратів відповідно до винаходу:

1. Продукти для розведення водою.

А. Розчинні у воді концентрати (SL, LS)

10 мас. частин сполуки, застосовуваної відповідно до винаходу, розчиняють, застосовуючи 90 мас. частин води або водорозчинного розчинника. Альтернативно, додають змочувальні агенти або інші допоміжні засоби. При розведенні водою активна сполука розчиняється. Це приводить до препарату, який містить 10% активної речовини.

Б. Концентрати, здатні до диспергування (DC)

20 мас. частин сполуки, застосовуваної відповідно до винаходу, розчиняють в 70 мас. частинах циклогексанону з додаванням 10 частин за масою диспергатора, наприклад, полівінілпіролідону. При розведенні водою утворюється дисперсія. Вміст активної речовини становить 20 мас.%.
В. Концентрати, здатні до емульгування (EC)

15 мас. частин сполуки, застосовуваної відповідно до винаходу, розчиняють в 75 мас. частинах ксилолу при додаванні додецилбензолсульфонату кальцію й етоксилату рицинової олії (у кожному випадку до 5%-ої концентрації). При розведенні водою одержують емульсію. Препарат має вміст активної речовини 15%.

Г. Емульсії (EW, EO, ES)

25 мас. частин сполуки, застосовуваної відповідно до винаходу, розчиняють в 35 мас. частинах ксилолу при додаванні додецилбензолсульфонату кальцію й етоксилату рицинової олії (у кожному випадку до 5%-ої концентрації). Цю суміш вводять в 30 мас. частин води за допомогою емульгуючого пристрою (наприклад, Ultraturrax) і доводять до гомогенної емульсії. При розведенні водою одержують емульсію. Препарат має вміст активної речовини 25%.

Д. Суспензії (SC, OD, FS)

20 мас. частин сполуки, застосовуваної відповідно до винаходу, подрібнюють при додаванні 10 мас. частин диспергаторів, змочувальних агентів і 70 мас. частин води або органічного розчинника в кульовому млині з мішалкою з одержанням тонкої суспензії активної сполуки. При розведенні водою одержують стабільну суспензію активної сполуки. Вміст активної речовини в препараті становить 20 мас.%.
Е. Гранули, що диспергуються у воді та розчинні у воді гранули (WG, SG)

50 мас. частин сполуки, застосовуваної відповідно до винаходу, тонко подрібнюють при додаванні 50 мас. частин диспергаторів і змочувальних агентів і за допомогою технічних пристроїв (наприклад, екструзійного пристрою, розпилювальної башти, псевдозрідженого шару) одержують гранули, які диспергуються у воді або розчинні у воді. При розведенні водою одержують стабільну дисперсію або розчин активної сполуки. Препарат має вміст активної речовини 50 мас.%.
Є. Порошки, що диспергуються у воді та розчинні у воді порошки (WP, SP, SS, WS)

75 мас. частин сполуки, застосовуваної відповідно до винаходу, перемелюють у роторно-статорному млині при додаванні 25 мас. частин диспергаторів, змочувальних агентів і силікагелю. При розведенні водою одержують стабільну дисперсію або розчин активної сполуки. Вміст активної речовини в препараті становить 75 мас.%.
Ж. Гелеподібні препарати

20 мас. частин сполуки, застосовуваної відповідно до винаходу, подрібнюють при додаванні 10 мас. частин диспергаторів, 1 мас. частини желувальної речовини та 70 мас. частин води або органічного розчинника в кульовому млині з одержанням тонкої суспензії. При розведенні водою одержують стабільну суспензію з вмістом активної речовини 20 мас.%.

2. Продукти для застосування в нерозбавленому вигляді.

3. Порошки для розпилення (DP, DS)

5 мас. частин сполуки, застосовуваної відповідно до винаходу, тонко подрібнюють і ретельно перемішують із 95 мас. частинами тонкоподрібненого каоліну. Це приводить до продукту для розпилення з вмістом активної речовини 5 мас.%.

II. Гранулят (GR, FG, GG, MG)

0.5 мас. частин сполуки, застосовуваної відповідно до винаходу, тонко подрібнюють і зв'язують із 95.5 мас. частин носіїв. Звичайними методами, застосовуваними при цьому, є екструзія, розпилювальне сушіння або обробка в псевдозрідженому шарі. Це приводить до грануляту для застосування в нерозбавленому вигляді з вмістом активної речовини 0,5 мас.%.

I. ULV розчини (UL)

10 мас. частин сполуки, застосовуваної відповідно до винаходу, розчиняють в 90 мас. частинах органічного розчинника, наприклад, ксилолу. Це приводить до продукту для застосування в нерозбавленому вигляді з вмістом активної речовини 10 мас.%.

Препарати, застосовувані для обробки насіння, звичайно являють собою розчинні у воді концентрати (LS), суспензії (FS), порошки для розпилення (DS), диспергуючі у воді порошки та розчинні у воді порошки (WS, SS), емульсії (ES), концентрати, здатні до емульгування (EC) і гелеподібні препарати (GF). Ці препарати можна наносити на насіння в нерозбавленому або, переважно, розведеному вигляді. Нанесення може здійснюватися перед посівом.

Для обробки зерна краще використовувати FS препарати. Звичайно, такі препарати включають від 1 до 800 г/л активної речовини, від 1 до 200 г/л поверхнево-активних речовин, від 0 до 200 г/л протиморозних добавок, від 0 до 400 г/л зв'язувальних речовин, від 0 до 200 г/л барвників і розчинників, переважно води.

Активні речовини можуть використовуватися як такі, у вигляді своїх препаративних форм або у формах, що приготують із них, наприклад, у вигляді призначених для безпосереднього розбризкування розчинів, порошоків, суспензій або дисперсій, емульсій, масляних дисперсій, паст, порошокоподібних продуктів, матеріалів для розкидання або грануляту шляхом обприскування, дрібнокрапельного обприскування, обпилювання, розкидання або поливу. Форми застосування повністю залежать від мети застосування; у кожному випадку повинен бути забезпечений максимально тонкий і рівномірний розподіл активних інгредієнтів відповідно до винаходу.

Застосовувані водні форми можуть бути приготувані з емульгувальних концентратів, паст або змочувальних порошоків (порошків для розпилення,

масляних дисперсій) шляхом додавання води. Для одержання емульсій, паст або масляних дисперсій речовини можна як такі або розчинені в маслі або розчиннику гомогенізувати у воді за допомогою змочувального агента, речовини для підвищення клейкості, диспергатора або емульгатора. Альтернативно, можуть бути приготувані концентрати, придатні для розведення водою, які складаються з активного інгредієнта та змочувального агента, речовини для підвищення клейкості, диспергатора або емульгатора та, якщо прийнятно, розчинника або масла.

Різні типи масел, змочувальних агентів, ад'ювантів, гербіцидів, інших пестицидів або бактеріцидів можна додавати до активних речовин, при необхідності, безпосередньо перед застосуванням (бакові суміші). Ці агенти можуть знаходитися в суміші з агентами відповідно до винаходу в масовому співвідношенні від 1:100 до 100:1, краще від 1:10 до 10:1.

Активні сполуки, застосовувані відповідно до винаходу можуть також бути присутніми разом з іншими активними речовинами, наприклад з гербіцидами, інсектицидами, регуляторами росту, фунгіцидами або, крім того, з добривами. Змішування відповідних активних сполук, зокрема сполук формули I або композицій, що їх містять, з однією або декількома додатковими активними речовинами, зокрема фунгіцидами, у багатьох випадках може розширювати спектр дії або попереджати розвитку стійкості. У багатьох випадках у підсумку можна спостерігати синергетичний ефект.

Наступний перелік фунгіцидів, разом з якими можуть застосовуватися сполуки, придатні для застосування в способі відповідно до винаходу, призначений для ілюстрації можливих комбінацій без накладення будь-яких обмежень:

Карбоксаміди

- карбоксаніліди: беналаксил, беноданіл, боскалід, карбоксин, мепроніл, фенфурам, фенгексамід, флутоланіл, фураметпір, металаксил, офураце, оксадиксил, оксикарбоксин, пентіопірад, тифлузамід, тіадиніл, N-(4'-бромбіфеніл-2-іл)-4-дифторметил-2-метилтіазол-5-карбоксамід, N-(4'-трифторметилбіфеніл-2-іл)-4-дифторметил-2-метилтіазол-5-карбоксамід, N-(4'-хлор-3'-фторбіфеніл-2-іл)-4-дифторметил-2-метилтіазол-5-карбоксамід, N-(3',4'-дихлор-4-фторбіфеніл-2-іл)-3-дифторметил-1-метилпіразол-4-карбоксамід, N-(3',4'-дихлор-5-фторбіфеніл-2-іл)-3-дифторметил-1-метилпіразол-4-карбоксамід, N-(2-ціанофеніл)-3,4-дихлорізотіазол-5-карбоксамід;

- морфоліди карбонових кислот: диметоморф, флуморф;

- бензаміди: флуметовер, флуопіколід (пікобензамід), зоксамід;

- інші карбоксаміди: карпропамід, диклоцимет, мандипропамід, N-(2-(4-[3-(4-хлорфеніл)проп-2-інілокси]-3-метоксифеніл)етил)-2-метансульфоніламіно-3-метилбутирамід, N-(2-(4-[3-(4-хлорфеніл)проп-2-інілокси]-3-метоксифеніл)-етил)-2-етансульфоніламіно-3-метилбутирамід;

Азоли

- триазоли: бітертанол, бромуконазол, ципроконазол, дифеноконазол, диніконазол, енілконазол, епоксиконазол, фенбуконазол, флузилазол,

флукхоназол, флутриафол, гексаконазол, імібенконазол, іпконазол, метконазол, міклобутаніл, пенконазол, пропіконазол, протіконазол, симеконазол, тебуконазол, тетраконазол, триадименол, триадимефон, трітіконазол;

- імідазоли: ціазофамід, імазаліл, пефуразоат, прохлораз, трифлумізол;

- бензімідазоли: беноміл, карбендазим, фуберидазол, тіабендазол;

- інші: етабоксам, етридіазол, гімексазол;

Азотомісні гетероциклічні сполуки

- піридини: флуазинам, пірифенокс, 3-[5-(4-хлорфеніл)-2,3-диметилізоксазолідин-3-іл]піридин;

- піримідини: бупіримат, ципродиніл, феримзон, фенаримол, меланіпірим, нуаримол, піриметаніл;

- піперазини: трифорин;

- піроли: флудіоксоніл, фенпиклоніл;

- морфоліни: алдидморф, додеморф, фенпропіморф, тридеморф;

- дикарбоксиміди: іпродіон, процимідон, вінклозолін;

- інші: ацибензолар-S-метил, анілазин, каптан, каптафол, дазомет, дикломезин, феноксаніл, фолпет, фенпропідин, фамоксадон, фенамідон, октилінон, пробеназол, проквіназид, піроквілон, квінкисифен, трициклазол, 5-хлор-7-(4-метилпіперидин-1-іл)-6-(2,4,6-трифторофеніл)-[1,2,4]триазоло[1,5-а]піримідин, 2-бутоксиг-6-йод-3-пропілхромен-4-он, N,N-диметил-3-(3-бром-6-фтор-2-метиліндол-1-сульфоніл)-[1,2,4]триазол-1-сульфонамід;

Карбамати та дитіокарбамати

- дитіокарбамати: фербам, манкозеп, манеб, метирам, метам, пропінеб, тирам, зинеб, зирам;

- карбамати: діетофенкарб, флубентіавалікарб, іпровалікарб, пропамокарб, метил-3-(4-хлорфеніл)-3-(2-ізопропоксикарбоніламіно-3-метилбутириламіно)пропіонат, 4-фторфеніл-N-(1-(4-ціанофеніл)етансульфоніл)бут-2-іл)карбамат;

Інші фунгіциди

- гуанідини: додин, іміноктадин, гуазатин;

- антибіотики: казугаміцин, поліоксини, стрептоміцин, валідаміцин А;

- металоорганічні сполуки: солі фентину;

- сірковмісні гетероциклічні сполуки: ізопротіолан, дитіанон;

- фосфорорганічні сполуки: едифенфос, фосетил, фосетил-алюміній, іпробенфос, піразофос, толклофос-метил, фосфориста кислота і її солі;

- хлорорганічні сполуки: тіофанатметил, хлороталоніл, дихлофлуанід, толілфлуанід, флузулфамід, фталід, гексахлорбензол, пенцикурон, квінтоцен;

- нітрофенілові похідні: бінапакрил, динокап, динобутон;

- неорганічні активні сполуки: Бордоська рідина, ацетат міді, гідроксид міді, оксихлорид міді, основний сульфат міді, сірка;

- інші: спіроксамін, цифлуфенамід, цимоксаніл, метрафенон.

Таким чином, у наступному варіанті винаходу, активна сполука, яка інгібує мітохондріальний дихальний ланцюг на рівні Ї/сі комплексу, зокрема сполука формули І, застосовується разом з додатковою фунгіцидною сполукою, переважно з одним з вищезгаданих фунгіцидів.

Даний винахід також пропонує спосіб одержання рослини, яка є толерантною до шкідливих грибів, який включає обробку рослини, ґрунту, у якому рослина виростає, і/або насіння рослини ефективною кількістю визначеної вище сполуки, яка інгібує мітохондріальний дихальний ланцюг на рівні Ї/сі комплексу. Кращі варіанти здійснення цього способу подібні таким описаним вище.

Надзвичайно краще, якщо в цьому способі активна сполука вибрана з піраклостробіну, крезоксим-метилу, димоксистробіну, метил-2-(орто-((2,5-диметил-фенілоксиметил)феніл)-3-метоксиакрилату, піоксистробіну, трифлуксистробіну, енестробурину, оризастробіну, метоміностробіну, азоксистробіну та флуоксистробіну.

Крім того, відповідно до одного варіанта, рослина переважно являє собою польову культуру. Більш краще, рослина являє собою зернову культуру, зокрема, пшеницю.

Відповідно до ще одного варіанта, шкідливим грибом є *Septoria* spp., зокрема, *Septoria tritici*.

Відповідно до ще одного варіанта, рослина являє собою багаторічну рослину, зокрема, виноградну лозу.

Відповідно до ще одного варіанта, шкідливими грибами є *Botrytis cinerea*, *Plasmopara viticola*, *Erysiphe necator* і/або еска.

Відповідно до ще одного варіанта, активну сполуку, зокрема, сполуку формули І, застосовують разом з додатковою фунгіцидною сполукою для того, щоб одержати рослину, толерантну до шкідливих грибів.

Також, у рамках даного винаходу, несподівано встановлено, що 5-хлор-7-(4-метилпіперидин-1-іл)-6-(2,4,6-трифторфеніл)-[1,2,4]триазоло[1,5-а]піримідин ефективний для індукування стійкості рослин до шкідливих грибів. Таким чином, наступним варіантом даного винаходу є спосіб індукування стійкості рослин до шкідливих грибів, який включає обробку рослини, ґрунту, у якому рослина виростає або буде виростати, і/або насіння рослини ефективною кількістю 5-хлор-7-(4-метилпіперидин-1-іл)-6-(2,4,6-трифторфеніл)-[1,2,4]триазоло[1,5-а]піримідину або його солі.

Приклади, які наведені нижче, призначені для ілюстрації винаходу, але не будь-яких обмежень.

Приклад 1

1.1. Експеримент

У дослідженні використовували сіянці пшениці на стадії 2-го листка. Рослини вирощували окремо в горщиках і розділяли на дві групи. Перші листки обприскували піраклостробіном при рекомендованій витраті (перші листки контролів обприскували дистильованою водою), і рослини, використовували для оцінки розвитку хвороби, один раз інокулювали *S. tritici*, після чого листки висушували. Перші та другі листки інокулювали шляхом обприскування суспензією спор густиною 1×10^5 спор/мл дистильованої води, яка містить невелику кількість Tween 20. Безпосередньо після інокуляції, горщики поміщали в насичені водяними парами ящики та закривали прозорими поліетіленовими пакетами на 48 год. Потім рослини вирощували при 18°C, чергуючи 12 год утримання при освітленні та 12 год - у темряві. Ступінь інфікування оцінювали на 18 день

після інокуляції шляхом визначення ураженої площі листків у %.

1.2. Результати

Нанесений на перші листки піраклостробін знижував, у порівнянні з необробленим контролем, інфікування *S. tritici* перших та других листків, (Таблиця 1). Таким чином, через 18 днів, фунгіцид

знижував інфікування перших та других листків на 65% і 61% відповідно (Таблиця 1).

Ці дані показують, що піраклостробін знижує інфікування *S. tritici* перших та других листків сійок пшениці більш ніж на 60%. Цей ефект є несподіваним, оскільки застосований у цьому дослідженні ізолят *S. tritici* є стійким до піраклостробіну.

Таблиця 1

Вплив обробки перших листків сійок пшениці піраклостробіном на інфікування *S. tritici* перших та других листків

Обробка	Інфікування (% ураженої поверхні листків)	
	Перший листок	Другий листок
Відсутність обробки	48±5.3	41±5.2
Піраклостробін	17±2.3	16±1.4

Значення представлені у вигляді середньої величини $\pm SE$ 10 повторень. Обидві обробки достовірні при $P < 0.01$ (критерій Ст'юдента).

Отже, ці дані вказують на те, що піраклостробін індукує у пшениці стійкість до патогену *Septoria tritici*.