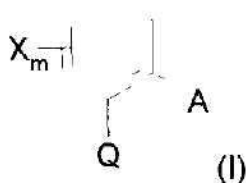


Винахід відноситься до способу імунізації рослин проти бактеріозів (бактеріальних хвороб), який відрізняється тим, що рослини, ґрунт або посівні матеріали обробляють ефективною кількістю сполуки формули I



де

X позначає галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкіл або трифторметил;

m дорівнює 0 або 1;

Q позначає групи C(=CH-CH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>, C(=CH-OCH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>

C(=N-OCH<sub>3</sub>)-CONHCH<sub>3</sub>, C(=N-OCH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub> або N-(OCH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>;

A позначає -O-B, -CH<sub>2</sub>O-B, -CH<sub>2</sub>S-B, -OCH<sub>2</sub>-B, -CH=CH-B, -C≡C-B, CH<sub>2</sub>O-N=C(R<sup>1</sup>)-B або -CH<sub>2</sub>O-N=C(R<sup>1</sup>)-C(R<sup>2</sup>)=N-OR<sup>3</sup>, причому

B позначає феніл, нафтил, 5-членний або 6-членний гетарил або 5-членний або 6-членний гетероцикліл, який містить від одного до трьох N-атомів та/або один O- або S-атом або один або два O- та/або S-атома, причому циклічна система заміщена або незаміщена за допомогою від одного до трьох залишків R<sup>a</sup>;

R<sup>a</sup> позначає ціано, нітро, аміно, амінокарбоніл, амінотіокарбоніл, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілкарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілсульфоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілсульфоксил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілоксикарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламіно, ди- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламіно, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламінокарбоніл, ди- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламінокарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламініотіокарбоніл, ди- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламініотіокарбоніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкеніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкенілокси, феніл, фенокси, бензил, бензилокси, 5- або 6-членний гетероцикліл, 5- або 6-членний гетарил, 5- або 6-членний гетарилокси, C(=NOR<sup>a</sup>)-OR<sup>b</sup> або OC(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>-C(R<sup>b</sup>)=NOR<sup>b</sup> причому циклічні залишки заміщені або незаміщені за допомогою від одного до трьох залишків R<sup>b</sup>;

R<sup>b</sup> позначає ціано, нітро, галоген, аміно, амінокарбоніл, амінотіокарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілсульфоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілсульфоксил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілоксикарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламіно, ди- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламіно, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламінокарбоніл, ди- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламінокарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламініотіокарбоніл, ди- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламініотіокарбоніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкеніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкенілокси, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкіл, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкеніл, феніл, фенокси, фенілтіо, бензил, бензилокси, 5- або 6-членний гетероцикліл, 5- або 6-членний гетарил, 5- або 6-членний гетарилокси або C(=NOR<sup>a</sup>)-OR<sup>b</sup>;

R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup> позначають водень або C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл;

R<sup>1</sup> позначає водень, ціано, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкіл, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси;

R<sup>2</sup> позначає феніл, фенілкарбоніл, фенілсульфоніл, 5- або 6-членний гетарил, 5- або 6-членний гетарилкарбоніл або 5- або 6-членний гетарилсульфоніл, причому циклічні системи заміщені або незаміщені за допомогою від одного до трьох залишків R<sup>a</sup>;

C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-алкіл, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-алкеніл, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-алкілтіл, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-алкілкарбоніл, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-алкенілкарбоніл, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-алкілкарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-алкілсульфоніл, або C(R<sup>a</sup>)=NOR<sup>b</sup>, причому вуглеводневі залишки цих груп заміщені або незаміщені за допомогою від одного до трьох залишків R<sup>c</sup>;

R<sup>c</sup> позначає водень, нітро, аміно, амінокарбоніл, амінотіокарбоніл, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілсульфоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілсульфоксил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілоксикарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламіно, ди- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламіно, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламінокарбоніл, ди- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламінокарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламініотіокарбоніл, ди- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламініотіокарбоніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкеніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкенілокси

C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкіл, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкілокси, 5- або 6-членний гетероцикліл, 5- або 6-членний гетарилокси, бензил, бензилокси, феніл, фенокси, фенілтіо, 5- або 6-членний гетарил, 5- або 6-членний гетарилокси та гетарилтіо, причому циклічні групи в свою чергу можуть бути частково або повністю галогеновані або можуть мати від одного до трьох залишків R<sup>a</sup>, та R<sup>3</sup> позначає водень, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкеніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкілтіл, причому вуглеводневі залишки цих груп незаміщені або заміщені за допомогою від одного до трьох залишків R<sup>c</sup>;

які засвоюються рослинами або посівним матеріалом. Разом із цим винахід відноситься загалом до застосування сполук формули I для імунізації рослин проти бактеріозів.

Бактерії зустрічаються в помірних та волого-теплих кліматичних регіонах як збудники хвороб (бактеріальних хвороб) на численних рослинах. Внаслідок цих хвороб серед іншого виникають великі економічні втрати. Загалом відомо, наприклад, викликане різними видами *Erwinia* відмирання всіх плодово-ягідних насаджень („бактеріальний опік” на грушах та яблуках), а також мокра гнилизна на картоплі та багатьох інших рослинах, різні, викликані агробактеріями пухлини рослин та викликані *Xanthomonaden* некрози на різних видах овочевих культурах, рисі, пшениці та цитрусових. Особливо небезпечними є викликані *Pseudomonaden* бактеріози, зокрема, на овочевих, деревних та чагарникових плодівих культурах і на тютюнових рослинах.

Звичайні фунгіциди, які втручаються в специфічні грибам процеси обміну речовин, не діють проти бактеріозів, що не є несподіваним. Боротьба з ними дотепер була можлива тільки через застосування антибіотиків (наприклад, стрептоміцину, бластицидину S або казуаміцину), що проте рідко практикувалося. Великомасштабне застосування антибіотиків в сільському господарстві є спірним, оскільки при цих антибіотиках застосовуються у принципі ті ж механізми дії, що і проти бактеріальних патогенів у медицині та ветеринарній медицині. Разом з цим вони можуть сприяти розвитку резистентності. До того ж антибіотики внаслідок їх в основному складної молекулярної структури є дорогими і можуть бути одержані тільки

біотехнологічним шляхом.

Вигідним принципом тому являє собою використання, відповідно, стимуляція властивих рослинам захисних механізмів.

У європейській заявці [EP-A 420 803] описується імунізуюча дія похідних бензо-1,2,3-тіазолів проти різних фітопатогенних мікроорганізмів. З міжнародної заявки [WO-A 96/37493] відома подібна дія піридилтіазолів. Проте дія цих речовин у багатьох випадках є незадовільною.

Завдання даного винаходу полягає в розробці способу широкого застосування, який не інтерферує з механізмами боротьби з бактеріозами у людини або тварини, екологічно та токсикологічно не шкідливий, який не ушкоджує рослини і забезпечує ефективну імунізацію проти фітобактеріозів.

У відповідності з цим був розроблений вищенаведений спосіб. Діючі речовини, які використовують, відомі як фунгіциди і, в даний час також й як інсектициди [див. документи EP-A 178 826; EP-A 253 213; WO-A 93/15046; WO-A 95/18789; WO-A 95/21153; WO-A 95/21154; WO-A 95/24396; WO-A 96/01256; WO-A 97/15552]. Результатів по стимуляції „імунної системи” рослин, яка приводить до стійкості проти бактеріозу, дотепер не було.

Гарна переносність рослинами діючих речовин формули I в необхідних для боротьби з хворобами рослин концентраціях дозволяють як обробку надземних частин рослин, так і обробку посадочного та посівного матеріалу і ґрунту.

При способі згідно із винаходом діюча речовина сприймається рослинами або через поверхню листя або через коріння рослин і розподіляється в рослинному соку по всій рослині.

Таким чином захисна дія настає після застосування способу відповідно до винаходу не тільки на частинах рослин, які безпосередньо обприскані, але і підвищується стійкість проти бактеріозу всієї рослини.

При переважній формі здійснення способу відповідно до винаходу надземні частини рослин обробляють препаративними формами діючої речовини формули I.

Отримання діючої речовини, яку використовують в способі відповідно до винаходу відомо з вищенаведених публікацій.

Для способу відповідно до винаходу особливо переважні діючі речовини з наступними значеннями замісників, як окремо, так і в комбінації.

Особливо переважні для способу відповідно до винаходу діючі речовини формули I, в якій Q позначає  $C(=CH-OCH_3)-COOCH_3$ ,  $C(=N-OCH_3)-COOCH_3$  або  $N(-OCH_3)-COOCH_3$ .

Переважними значеннями для залишку В у формулі I є феніл, піридил, піримідиніл, триазоліл та піразоліл.

Для способу відповідно до винаходу особливо переважні діючі речовини формул від II до VIII, в яких V позначає  $OCH_3$  та  $NHCH_3$ , особливо  $OCH_3$ ,

Y CH та Ч, та N та

T і Z позначають незалежно один від одного CH та N.

Переважними діючими речовинами формули I, при яких Q позначає  $N(-OCH_3)-COOCH_3$  є сполуки описані в публікаціях [WO-A 93/15046 та WO-A 96/01256].

Переважними діючими речовинами формули I, при яких Q позначає  $C(=CH-OCH_3)-COOCH_3$ , є сполуки описані в публікаціях [EP-A 178 826 та EP-A 278 595].

Переважними діючими речовинами формули I, при яких Q позначає  $C(=N-OCH_3)-COOCH_3$ , є сполуки описані в документах [EP-A 253 213 та EP-A 254 426].

Переважними діючими речовинами формули I, при яких Q позначає  $C(=N-OCH_3)-CONHCH_3$ , є сполуки описані в документах [EP-A 398 692, EP-A 477 631 та EP-A 628 540].

Переважними діючими речовинами формули I, при яких Q позначає  $C(=CH-CH_3)-COOCH_3$ , є сполуки описані в документах [EP-A 280 185 та EP-A350 691].

Переважними діючими речовинами формули I, при яких A позначає  $-CH_2O-N=C(R^1)-B$ , є сполуки описані в документах [EP-A 460 575 та EP-A 463 488].

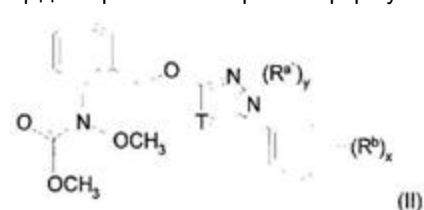
Переважними діючими речовинами формули I, при яких A позначає  $-O-B$ , є сполуки описані в документах [EP-A 382 375 та EP-A 398 692].

Переважними діючими речовинами формули I, при яких A позначає  $-CH_2O-N=C(R^1)-C(R^2)=N-OR^3$ , є сполуки описані в документах [WO-A 95/18789, WO-A 95/21153, WO-A 95/21154, WO-A 97/05103 та WO-A 97/06133].

Особливо переважні діючі речовини формули I, при яких Q позначає  $N(-OCH_3)-COOCH_3$ , A позначає  $CH_2-O-$  та

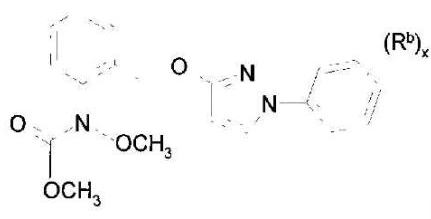
B позначає 3-піразоліл або 1,2,4-триазоліл, причому B може мати один або два замісники, вибрані з групи, яка включає галоген, метил та трифторметил, і феніл та піридил, зокрема, 2-піридил, причому ці залишки заміщені від 1 до 3 залишками  $R^b$ .

Ці діючі речовини виражені формулою II

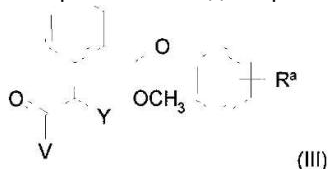


у якій  $R^a$  позначає хлор, метил або трифторметил,  $R^b$  має приведені для формули I значення та x дорівнює 1 або 2, а u дорівнює 0 або 1.

Особливо переважними є діючі речовини формули II':



Далі переважними є діючі речовини формули III:

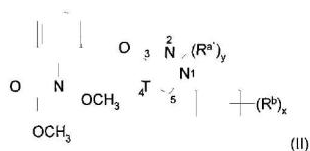


у якій V позначає  $\text{OCH}_3$  або  $\text{NHCH}_3$  та Y позначає N та  $\text{R}^a$  позначає галоген,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -алкіл,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -галогеналкіл або  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -галогеналкокси.

Особливо переважними є діючі речовини формули III, в якій V позначає  $\text{OCH}_3$  та  $\text{R}^a$  позначає галоген, метил, диметил або трифторметил, особливо, метил.

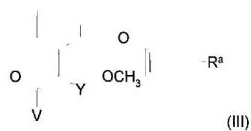
При урахуванні їх застосування особливо переважні приведені у нижченаведених таблицях сполуки.

Таблиця I



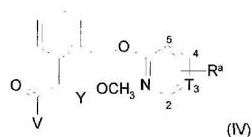
№	T	$(\text{R}^b)_y$	Положення групи феніл- $(\text{R}^b)_x$	$(\text{R}^b)_x$	Літ. джерела
I-1	N	-	1	2,4- $\text{Cl}_2$	WO-A 96/01256
I-2	N	-	1	4-Cl	WO-A 96/01256
I-3	CH	-	1	2-Cl	WO-A 96/01256
I-4	CH	-	1	3-Cl	WO-A 96/01256
I-5	CH	-	1	4-Cl	WO-A 96/01256
I-6	CH	-	1	4- $\text{CH}_3$	WO-A 96/01256
I-7	CH	-	1	H	WO-A 96/01256
I-8	CH	-	1	3- $\text{CH}_3$	WO-A 96/01256
I-9	CH	5- $\text{CH}_3$	1	3- $\text{CF}_3$	WO-A 96/01256
I-10	CH	1- $\text{CH}_3$	5	3- $\text{CF}_3$	WO-A 99/33812
I-11	CH	1- $\text{CH}_3$	5	4-Cl	WO-A 99/33812
I-12	CH	1- $\text{CH}_3$	5	-	WO-A 99/33812

Таблиця II



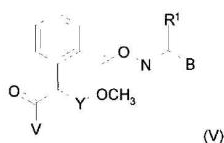
№	V	Y	$\text{R}^a$	Літ. джерела
II-1	$\text{OCH}_3$	N	2- $\text{CH}_3$	EP-A253 213
II-2	$\text{OCH}_3$	N	2,5- $(\text{CH}_3)_2$	EP-A253 213
II-3	$\text{NHCH}_3$	N	2,5- $(\text{CH}_3)_2$	EP-A 477 631
II-4	$\text{NHCH}_3$	N	2-Cl	EP-A 477 631
II-5	$\text{NHCH}_3$	N	2- $\text{CH}_3$	EP-A 477 631
II-6	$\text{NHCH}_3$	N	2- $\text{CH}_3$ , 4- $\text{OCF}_3$	EP-A 628 540
II-7	$\text{NHCH}_3$	N	2-Cl, 4- $\text{OCF}_3$	EP-A 628 540
II-8	$\text{NHCH}_3$	N	2- $\text{CH}_3$ , 4- $\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{NOCH}_3$	EP-A11 18 609
II-9	$\text{NHCH}_3$	N	2-Cl, 4- $\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{NOCH}_3$	EP-A11 18 609
II-10	$\text{NHCH}_3$	N	2- $\text{CH}_3$ , 4- $\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{-C}(\text{CH}_2\text{CH}_3)=\text{NOCH}_3$	EP-A11 18 609
II-11	$\text{NHCH}_3$	N	2-Cl, 4- $\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{NOCH}_2\text{CH}_3$	EP-A11 18 609

Таблиця III



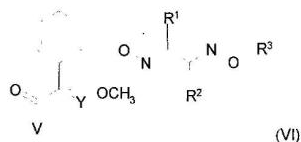
№	V	Y	T	R <sup>a</sup>	Літ. джерела
III-1	OCH <sub>3</sub>	CH	N	2-OCH <sub>3</sub> , 4-CF <sub>3</sub>	WO-A 96/16047
III-2	OCH <sub>3</sub>	CH	N	2-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub>	WO-A 96/16047
III-3	OCH <sub>3</sub>	CH	CH	2-CF <sub>3</sub>	EP-A 278 595
III-4	OCH <sub>3</sub>	CH	CH	3-CF <sub>3</sub>	EP-A 278 595
III-5	NHCH <sub>3</sub>	N	CH	3-Cl	EP-A 398 692
III-6	NHCH <sub>3</sub>	N	CH	3-CF <sub>3</sub>	EP-A 398 692
III-7	NHCH <sub>3</sub>	N	CH	3-CF <sub>3</sub> , 5-Cl	EP-A 398 692
III-8	NHCH <sub>3</sub>	N	CH	3-Cl, 5-CF <sub>3</sub>	EP-A 398 692

Таблиця IV



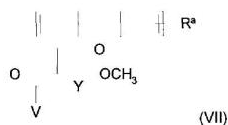
№	V	Y	R <sup>1</sup>	B	Літ. джерела
IV-1	OCH <sub>3</sub>	CH	CH <sub>3</sub>	(3-CF <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	EP-A 370 629
IV-2	OCH <sub>3</sub>	CH	CH <sub>3</sub>	(3,5-Cl <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	EP-A 370 629
IV-3	NHCH <sub>3</sub>	N	CH <sub>3</sub>	(3-CF <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	WO-A 92/13830
IV-4	NHCH <sub>3</sub>	N	CH <sub>3</sub>	(3-OCF <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	WO-A 92/13830
IV-5	OCH <sub>3</sub>	N	CH <sub>3</sub>	(3-OCF <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	EP-A 460 575
IV-6	OCH <sub>3</sub>	N	CH <sub>3</sub>	(3-CF <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	EP-A 460 575
IV-7	OCH <sub>3</sub>	N	CH <sub>3</sub>	(3,4-Cl <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	EP-A 460 575
IV-8	OCH <sub>3</sub>	N	CH <sub>3</sub>	(3,5-Cl <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	EP-A 463 488

Таблиця V



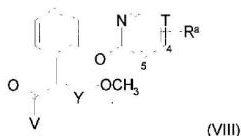
№	V	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Літ. джерела
V-1	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	WO-A 95/18789
V-2	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	WO-A 95/18789
V-3	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH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

Таблиця VI



№	V	Y	R <sup>a</sup>	Літ. джерела
VI-1	NHCH <sub>3</sub>	N	H	EP-A 398 692
VI-2	NHCH <sub>3</sub>	N	3-CH <sub>3</sub>	EP-A 398 692
VI-3	NHCH <sub>3</sub>	N	2-NO <sub>2</sub>	EP-A 398 692
VI-4	NHCH <sub>3</sub>	N	4-NO <sub>2</sub>	EP-A 398 692
VI-5	NHCH <sub>3</sub>	N	4-Cl	EP-A 398 692
VI-6	NHCH <sub>3</sub>	N	4-Br	EP-A 398 692

Таблиця VII



№	V	Y	T	R <sup>a</sup>	Літ. джерела
VII-1	OCH <sub>3</sub>	CH	N	4-O-(2-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	EP-A 382 375
VII-2	OCH <sub>3</sub>	CH	N	4-O-(2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	EP-A 382 375
VII-3	OCH <sub>3</sub>	CH	N	4-O-(2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	EP-A 382 375
VII-4	NHCH <sub>3</sub>	N	N	4-O-(2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	GB-A 22 53 624
VII-5	NHCH <sub>3</sub>	N	N	4-O-(2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> )	GB-A 22 53 624
VII-6	NHCH <sub>3</sub>	N	N	4-O-(2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	GB-A 22 53 624
VII-7	NHCH <sub>3</sub>	N	N	4-O-(2-CH <sub>3</sub> ,3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> )	GB-A 22 53 624
VII-8	NHCH <sub>3</sub>	N	N	4-O-(2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ),5-F	WO-A 98/21189
VII-9	NHCH <sub>3</sub>	N	N	4-O-(2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ),5-F	WO-A 98/21189
VII-10	NHCH <sub>3</sub>	N	N	4-O-(2-CH <sub>3</sub> ,3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> ),5-F	WO-A 98/21189
VII-11	NHCH <sub>3</sub>	N	N	4-O-(2-Cl,3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> ),5-F	WO-A 98/21189

Сполуки формули I підвищують стійкість рослин по відношенню до бактеріальних хвороб. Вони мають особливе значення при боротьбі з бактеріями на різних культурних рослинах, таких, як овочеві культури, деревні або чагарникові плодові породи і тютюнові рослини, а також на насінні цих рослин.

Особливо вони придатні для боротьби з наступними хворобами рослин: види *Pseudomonas* на тютюнових рослинах, картоплі, помідорах і бобових культурах і, зокрема, види *Erwinia* на плодівих, овочевих культурах і картоплі.

Сполуки формули II, зокрема, сполука 11-1, особливо придатні для боротьби з видами *Erwinia*.

Сполуки формули I застосовуються таким чином, що рослини, які підлягають захисту від бактерійного ураження, посівний матеріал або ґрунт обробляють ефективною кількістю діючих речовин. Застосування здійснюють перед інфекцією рослин або насінного матеріалу бактеріями. Внаслідок цього досягається значне зниження хвороб рослин до бактеріозу.

Норми витрати при застосуванні для захисту рослин залежно від виду збудника і виду рослини знаходяться в інтервалі від 0,01 до 2,0 кг діючої речовини на гектар.

При обробці посівного матеріалу загалом потрібна кількість діючої речовини від 0,001 до 0,1 г, переважно, від 0,01 до 0,05 г на кг посівного матеріалу.

Сполуки формули I можуть переводитися в звичайні для фунгіцидів препаративні форми, наприклад, розчини, емульсії, суспензії, пудри, порошки, пасти та грануляти. Форма застосування орієнтується на мету застосування, вона повинна у будь-якому випадку забезпечувати тонкий і рівномірний розподіл сполук згідно із винаходом.

Препаративні форми одержують відомим чином, наприклад, шляхом розбавлення діючої речовини розчинниками та/або наповнювачами, за бажанням при застосуванні емульгаторів та диспергаторів, причому у разі

води як розріджувача можуть застосовуватися інші органічні розчинники як допоміжні агенти. Як допоміжні агенти придатні продукти, звичайні для фунгіцидів.

Препаративні форми містять загалом між 0,01 та 95 мас.%, переважно між 0,1 та 90 мас.% діючої речовини. Діючі речовини мають при цьому чистоту від 90% до 100%, переважно, від 95% до 100% (за спектром ЯМР).

Приклади препаративних форм:

I. 5 ваг. частин сполуки згідно із винаходом ретельно перемішують з 95 ваг. частинами тонкого каоліну. Таким чином одержують засіб для обпилювання, який містить 5 мас.% діючої речовини.

II. 30 ваг. частин сполуки згідно із винаходом ретельно перемішують з 92 ваг. частинами порошкового силікагелю та 8 ваг. частинами парафінової олії, яку напирскують на поверхню цього силікагелю. Таким чином

одержують препаративну форму діючої речовини з гарною адгезивною здатністю (вміст діючої речовини 23мас.%).

III. 10ваг. частин сполуки згідно із винаходом розчиняють у суміші, яка складається з 90ваг. частин ксилолу, 6ваг. частин продукту приєднання від 8 до 10молей етиленоксиду до 1молю N-моноетаноламід у олеїнової кислоти, 2ваг. частин кальцієвої солі додецилбензолсульфокислоти та 2ваг. частин продукту приєднання 40молей етиленоксиду до 1молю касторової олії (вміст діючої речовини 9мас.%).

IV. 20 ваг. частин сполуки згідно із винаходом розчиняють у суміші, яка складається з 60 ваг. частин циклогексанону, 30ваг. частин ізобутанолу, 5ваг. частин продукту приєднання 7молей етиленоксиду до 1молю ізооктилфенолу та 5ваг. частин продукту приєднання 40молей етиленоксиду до 1молю касторової олії (вміст діючої речовини 16 мас.%).

V. 80ваг. частин сполуки згідно із винаходом добре перемішують з 3ваг. частинами натрієвої солі діізобутилнафталін-альфа-сульфокислоти, 10 ваг. частинами натрієвої солі лігнінсульфокислоти з сульфитного відпрацьованого луку та 7ваг. частинами порошкового силікагелю і перемелюють у молотковому млині (вміст діючої речовини 80мас.%).

VI. Перемішують 90ваг. частин сполуки згідно із винаходом з 10ваг. частинами N-метил-а-піролідону і одержують розчин, який придатний для застосування у формі найдрібніших крапель (вміст діючої речовини 90мас.%).

VII. 20ваг. частин сполуки згідно із винаходом розчиняють у суміші, яка складається з 40 ваг. частин циклогексанону, 30ваг. частин ізобутанолу, 20ваг. частин продукту приєднання 7молей етиленоксиду до 1молю ізооктилфенолу та 10ваг. частин продукту приєднання 40молей етиленоксиду до 1молю касторової олії. Шляхом концентрації та тонкого розподілу розчину у 100 000ваг. частинах води одержують водну дисперсію, яка містить 0,02 мас.% діючої речовини.

VIII. 20ваг. частин сполуки згідно із винаходом добре перемішують з 3ваг. частинами натрієвої солі діізобутилнафталін-а-сульфокислоти, 17ваг. частинами натрієвої солі лігнінсульфокислоти з сульфитного відпрацьованого луку та 60ваг. частинами порошкового силікагелю та перемелюють у молотковому млині. Шляхом тонкого розподілу суміші у 20000ваг. частинах води одержують розчин для обприскування, який містить 0,1мас.% діючої речовини.

Водні препаративні форми звичайно можуть бути приготовані з концентратів емульсій, паст або порошоків, які змочуються (порошки для розпилювання, масляні дисперсії), шляхом додавання води. Для виготовлення емульсій, паст або масляних дисперсій речовини як такі, чи ж розчинені у маслі, можуть гомогенізуватися у воді за допомогою змочувальних агентів, активаторів адгезії, диспергаторів або емульгаторів. Можуть також готуватися концентрати, які складаються з діючої речовини, змочувального агента, активатора адгезії, диспергатора або емульгатора і, можливо, з розчинника та олії, які можна розбавляти водою.

Концентрація діючої речовини в готових до застосування препаратах може варіюватися в широких межах. Загалом вона складає від 0,0001 до 10%, переважно, від 0,01 до 1%.

Діючі речовини можуть застосовуватися з успіхом при особливо низьких нормах витрати, причому є можливість використовувати препарати більш, чим з 95мас.% діючої речовини або навіть застосовувати діючу речовину без добавок.

До діючих речовин можуть додаватися олії різного типу, гербіциди, інші фунгіциди, інші засоби боротьби зі шкідниками, бактерициди, у разі потреби, також і безпосередньо перед застосуванням (суміші в баку). Ці засоби можуть домішуватися до засобів відповідно до винаходу у ваговому співвідношенні від 1:10 до 10:1.

Вказівка на дію індукованої стійкості діючої речовини формули I до бактерій може проводитися як нанесена на упаковку вказівка або у інформаційному листку продукту. Вказівка може бути проведена на препаратах, які можуть застосовуватися в комбінації з діючими речовинами формули I.

Індукція (стимулювання) стійкості може також бути індикацією, яка може бути предметом офіційного допуску до застосування діючої речовини формули I.

Дію сполук формули I можна показати наступними тестами. Приклади застосування для стимулювання стійкості до бактерій. Рослинний матеріал

Для тестів тютюнові рослини (*Nicotinia tabacum* cv. Xanthi-nc) вирощують при 25°C, 59% вологості повітря і щоденному світловому періоді в 16 годин ( $150\text{--}200\text{мкМ квант/с}^{-1}\text{м}^{-2}$ ) у період часу від 6 до 8 тижнів в пікірувальній ґрунто-суміші (типова суміш типу ED 73). Частину рослин удобрюють один раз на тиждень, шляхом додавання до поливальної води добрива для квітів, яке комерційно придбавають (10% загального азоту, 9% фосфату, 7% калію) в рекомендованому дозуванні.

Застосування діючої речовини

Діючу речовину як 0,1ммоль водного розчину (розбавленого 1% об/об диметилсульфоксидом) напірскують на рослини або інфільтрують безпосередньо у тканину листів за допомогою дуже тонкої ін'єкційної канюлі. Контрольні рослини аналогічно обробляють розчинами, які не містять діючої речовини. Для зниження впливу біологічного розсіяння в деяких тестах по половині листя (зліва та праворуч від середнього ребра) обробляють розчином діючої речовини, по іншій половині того ж листа обробляють контрольним розчином.

Після застосування та після подальшої інокуляції *Pseudomonas syringae* рослини залишають у розпліджувальній камері.

Інокуляція / інфекція та визначення стійкості

Оброблені як описано вище діючою речовиною тютюнові рослини, відповідно, листя, інфікують *Pseudomonas syringae* pv. tomato [штам DC3000; постачальник: Brian Staskawicz, University of California, Berkeley, CA] або [*Pseudomonas syringae* pv. tabaci (німецька колекція мікроорганізмів та клітинних культур, Брауншвейг, Німеччина)]. Для цього бактерії вирощують протягом 1 дня при 30°C в середовищі King's B, центрифугують, промивають та в розчині 10ммоль  $\text{MgCl}_2$  встановлюють на щільність  $10^5$  cfu мл<sup>-1</sup>. Близько 200мл ( $2 \times 10^4$  cfu мл<sup>-1</sup>) цього інокулята інфільтрують через маленькі ранки у листі, нанесені канюлею, безпосередньо в тканину листя.

Наступного тижня визначають розвиток некрозу листя як наслідок інфекції. Відсутність некрозних симптомів є при цьому характерним для індукованої стійкості тканини листя.

Визначення росту бактерій

Для кількісного визначення популяції бактерій вирізають по два шматки (0 1см) з інфікованої зони листя і гомогенізують у 500мл стерилізованої води. Ряд розбавлених препаратів поміщають на King's B агар та розраховують через 2 дні інкубації при 30°C з числа колоній, які утворилися, щільність початкової популяції (cfu) на одну шайбу листка.

Приклад застосування

Підвищена стійкість до *Pseudomonas syringae* pv. *tomato* DC3000 (несумісна взаємодія) та повільне утворення симптомів хвороби, викликаної *Pseudomonas syringae* pv. *tabaci* (сумісна взаємодія), на листі тютюну після обробки діючою речовиною I-5.

Приклад.1. Імунізація проти *Pseudomonas syringae* pv. *tabaci* (сумісна взаємодія)

Завдяки обробці (від 24 до 48 годин перед інокуляцією) за допомогою  $\leq 0,01\%$ -вої композиції діючої речовини I-5 у разі сумісної комбінації господар -патоген ріст бактерій пригнічується та знижується утворення симптомів хвороби.

Кінетика росту *Pseudomonas syringae* pv. *tabaci* після зараження King B-середовища колонією в присутності, відповідно у відсутності діючої речовини I-5 показує, що сама діюча речовина не має впливу на зростання бактерій *in vitro*.

Встановлений ефект заснований на стимуляції властивості рослини захисної здатності, відповідно, стійкості до патогена.

Таблиця А

Ріст *Pseudomonas syringae* pv. *tabaci* в інокульованому листі тютюнової рослини

Час t [год.]	Бактерії ( $\times 10^6$ клітин/мл (шайби листків <sup>-1</sup> ))	
	Діюча речовина I-5	Контроль
0	0	0
16	0,3	0,3
24	1,2	3,3
48	1,4	3,7

Приклад 2: Імунізація проти *Pseudomonas syringae* pv. *tomato* DC3000 несумісна взаємодія)

Також і у разі несумісної взаємодії (тобто рослина сама швидко реагує на введений патоген утворенням ("захисного") некрозу, при якому відмирають інфіковані зони листя і сильно знижується утворення симптомів.

Таблиця В

Розвиток ураження листя тютюну після інокуляції мікроберної зони за допомогою *Pseudomonas syringae* pv. *tomato* DC3000

Час [год.]	Зміни листя (% поверхні мікроберної зони)			
	Діюча речовина I-5		Контроль	
	Симптом в'янення	Відмирання (некроз)	Симптом в'янення	Відмирання (некроз)
0	0	0	0	0
24	0	0	100	0
48	0	5	-	100
72	0	8	-	100
144	0	15	-	100
168	0	20	-	100

Після застосування композиції діючої речовини I-5 малі некротичні зони обмежуються безпосередньо місцями інокуляції на ранках листя. Листя контрольних рослин через 24 години в'яне і через 48 годин повністю відмирають.