

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 202090434 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2020.07.31

(51) Int. Cl. A01N 57/24 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)

(22) Дата подачи заявки
2018.08.08

(54) СПОСОБЫ КОНТРОЛЯ ИЛИ ПРЕДУПРЕЖДЕНИЯ ЗАРАЖЕНИЯ РАСТЕНИЙ СОИ ФИТОПАТОГЕННЫМИ МИКРООРГАНИЗМАМИ

(31) 17185509.1; 17202349.1

(72) Изобретатель:

(32) 2017.08.09; 2017.11.17

Габертюэль Маттиас (CH)

(33) EP

(74) Представитель:

(86) PCT/EP2018/071558

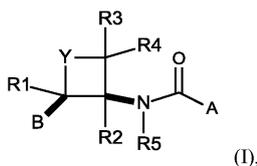
Веселицкая И.А., Веселицкий М.Б.,
Кузенкова Н.В., Каксис Р.А., Белоусов
Ю.В., Куликов А.В., Кузнецова Е.В.,
Соколов Р.А., Кузнецова Т.В. (RU)

(87) WO 2019/030307 2019.02.14

(71) Заявитель:

ЗИНГЕНТА ПАРТИСИПЕЙШНС АГ
(CH)

(57) Настоящее изобретение относится к способам контроля или предупреждения заражения сои фитопатогенными микроорганизмами, в частности рода *Fusarium*, *sclerotinia sclerotiorum*, *microsphaera diffusa*, *septoria glycines* и *cercospora sojina*, более конкретно *fusarium virguliforme*, *fusarium solani*, *fusarium oxysporum*, *fusarium acuminatum*, *fusarium chlamydosporum*, *fusarium compactum*, *fusarium culmorum*, *fusarium equiseti*, *fusarium graminearum*, *fusarium merismoides*, *fusarium proliferatum*, *fusarium pseudograminearum*, *fusarium semitectum*, *fusarium subglutinans* и *fusarium verticillioides*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с формулой (I)



где R1, R2, R3, R4, R5, Y, A, B определены в данном документе.

A1

202090434

202090434

A1

СПОСОБЫ КОНТРОЛЯ ИЛИ ПРЕДУПРЕЖДЕНИЯ ЗАРАЖЕНИЯ РАСТЕНИЙ СОИ ФИТОПАТОГЕННЫМИ МИКРООРГАНИЗМАМИ

5

Область техники

Настоящее изобретение относится к способам контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами, в частности рода *Fusarium*, *Sclerotinia sclerotiorum*, *Microsphaera diffusa*, *Septoria glycines* и *Cercospora sojina*.

10

Уровень техники

Синдром внезапной смерти (SDS) является одним из главных заболеваний, вызывающих снижение урожайности соевых бобов, особенно в США. За последние 15 пять лет среднегодовой ущерб, обусловленный SDS, составлял для производителей сои более 44 миллионов бушелей потерянного урожая, и при этом распространение заболевания продолжает расти. SDS вызван грибами рода *Fusarium*, более конкретно патогеном, передающимся через почву и корни, *Fusarium virguliforme*. Следовательно, существует необходимость в обеспечении эффективных альтернативных способов 20 контроля или предупреждения заражения данным вредителем и другими вредителями, такими как стволовая гниль, вызванная склеротинией (белая гниль), милдью, септория, селенофомозная пятнистость листьев у сои.

20

Таким образом, настоящее изобретение предусматривает дополнительные способы контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными 25 микроорганизмами, в частности рода *Fusarium*, более конкретно *Fusarium virguliforme*.

25

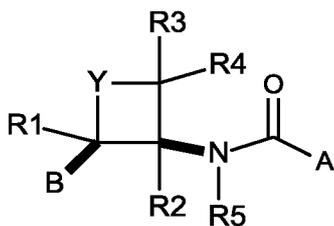
Описание вариантов осуществления

Циклобутилкарбоксамидные соединения и способы их получения были раскрыты в WO 2013/143811 и WO 2015/003951. В настоящее время неожиданно было обнаружено, 30 что конкретные циклобутилкарбоксамидные соединения, раскрытые в WO 2013/143811 и/или WO 2015/003951, являются высокоэффективными для контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами рода *Fusarium*, в частности *Fusarium virguliforme*. Таким образом, эти высокоэффективные

30

соединения представляют собой важное новое решение для фермеров в отношении контроля или предупреждения заражения растений сои синдромом внезапной смерти.

5 Следовательно, в качестве варианта осуществления 1 предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами, в частности рода *Fusarium*,
sclerotinia sclerotiorum, *microspheera diffusa*, *septoria glycines* и *cercospora soja*,
 более конкретно *fusarium virguliforme*, *fusarium solani*, *fusarium oxysporum*, *fusarium acuminatum*, *fusarium chlamydosporum*, *fusarium compactum*, *fusarium culmorum*, *fusarium*
 10 *equiseti*, *fusarium graminearum*, *fusarium merismoides*, *fusarium proliferatum*, *fusarium pseudograminearum*, *fusarium semitectum*, *fusarium subglutinans* и *fusarium verticilliodes*,
 включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с формулой (I),



15

(I),

где

Y представляет собой O, C=O или CR₁₂R₁₃;

20 A представляет собой 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, содержащее 1-3 гетероатома, каждый из которых независимо выбран из кислорода, азота и серы, или фенильное кольцо; при этом гетероароматическое кольцо или фенил необязательно замещены одним или несколькими R₆;

R₆ независимо от других представляет собой галоген, циано, C1-C4-алкил, C1-C4-галогеналкил, C1-C4-алкокси, C1-C4-галогеналкокси, C1-C4-галогеналкилтио, C1-C4-
 25 алкокси-C1-4-алкил или C1-C4-галогеналкокси-C1-C4-алкил;

R₁, R₂, R₃, R₄, R₁₂ и R₁₃ независимо друг от друга представляют собой водород, галоген, циано, C1-C4-алкил, C1-C4-алкокси или C1-C4-галогеналкил,

R₅ представляет собой водород, метокси или гидроксил,

B представляет собой фенил, замещенный одним или несколькими R₈,

R8 независимо от других представляет собой галоген, циано или группу $-L-R9$, где каждый L независимо от других представляет собой связь, $-O-$, $-OC(O)-$, $-NR7-$, $-NR7CO-$, $-NR7S(O)_n-$, $-S(O)_n-$, $-S(O)_nNR7-$, $-COO-$ или $CONR7-$,
n равняется 0, 1 или 2,

5 R7 представляет собой водород, C1-C4-алкил, C1-C4-галогеналкил, бензил или фенил, где бензил и фенил являются незамещенными или замещенными галогеном, циано, C1-C4-алкилом или C1-C4-галогеналкилом;

R9 независимо от других представляет собой, C1-C6-алкил, который является незамещенным или замещенным одним или несколькими R10, C3-C6-циклоалкил,
10 который является незамещенным или замещенным одним или несколькими R10, C6-C14-бициклоалкил, который является незамещенным или замещенным одним или несколькими R10, C2-C6-алкенил, который является незамещенным или замещенным одним или несколькими R10, C2-C6-алкинил, который является незамещенным или замещенным одним или несколькими R10, фенил, который является незамещенным или
15 замещенным R10, или гетероарил, который является незамещенным или замещенным одним или несколькими R10,

R10 независимо от других представляет собой галоген, циано, C1-C4-алкил, C1-C4-галогеналкил, C1-C4-алкокси, C1-C4-галогеналкокси, C1-C4-алкилтио, C1-C4-галогеналкилтио, C3-C6-алкенилокси или C3-C6-алкинилокси;

20 или его соли или N-оксида;

где B и A-CO-NR5 находятся в цис-положении по отношению друг к другу в четырехчленном кольце,

или таутомера или стереоизомера этих соединений.

25 Более предпочтительные способы в соответствии с вариантом осуществления 1 представлены в вариантах осуществления ниже.

В качестве варианта осуществления 2 предусмотрен способ в соответствии с вариантом осуществления 1, где

30 Y представляет собой O или CH_2 ;

A представляет собой 6-членное гетероароматическое кольцо, содержащее 1-2 атома азота, или фенильное кольцо; при этом гетероароматическое кольцо или фенил обязательно замещены одним или несколькими R6;

R6 независимо от других представляет собой галоген, циано, C1-C4-алкил, C1-C4-галогеналкил или C1-C4-галогеналкокси;

каждый из R1, R2, R3, R4 и R5 представляет собой водород;

В представляет собой фенил, замещенный одним или несколькими R8;

- 5 R8 независимо от других выбран из галогена, циано, C1-C4-алкила, C1-C4-галогеналкила, C1-C4-галогеналкокси и C3-C6-циклоалкила.

- 10 В качестве варианта осуществления 3 предусмотрен способ в соответствии с вариантом осуществления 1 или вариантом осуществления 2, где А представляет собой 6-членное гетероароматическое кольцо, содержащее 1-2 атома азота и имеющее 1-3 заместителя, выбранных из R6, или фенильное кольцо, имеющее 1 или 3 заместителя, выбранных из R6.

- 15 В качестве варианта осуществления 4 предусмотрен способ в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-3, где В представляет собой фенил, замещенный 1-3 заместителями, представляющими собой R8.

- 20 В качестве варианта осуществления 5 предусмотрен способ в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-4, где В представляет собой фенил, замещенный 1-3 заместителями, независимо выбранными из фтора, хлора, трифторметила, циклопропила, дифторметокси и трифторметокси;
- А представляет собой фенил, пиридил или пиразинил, кольца которых независимо друг от друга являются незамещенными или замещенными 1-3 заместителями, независимо выбранными из хлора, брома, фтора, метила, циано и трифторметила, Y представляет собой O или CH₂, и каждый из R1, R2, R3, R4 и R5 представляет собой водород.
- 25

В качестве варианта осуществления 6 предусмотрен способ в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-5, где

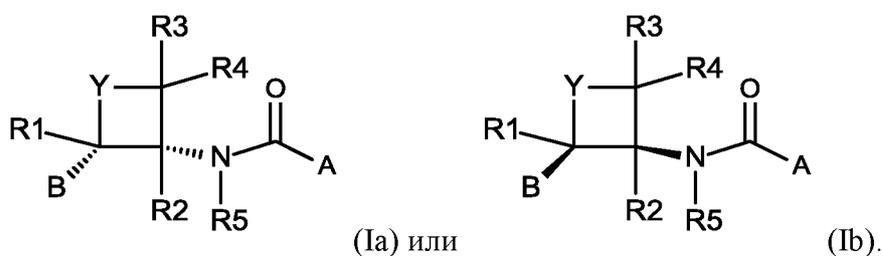
Y представляет собой CH₂;

- 30 В представляет собой моно- или дизамещенный галогеном фенил;

А выбран из фенила, пиразинила и пиридила, каждый из которых является моно- или дизамещенным заместителями, независимо выбранными из галогена и C1-C4-галогеналкила;

каждый из R1, R2, R3, R4 и R5 представляет собой водород.

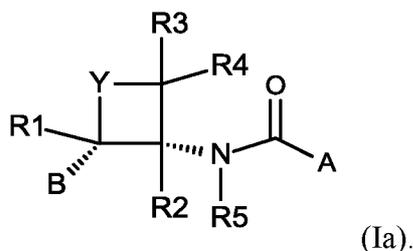
Соединения формулы (I), раскрытые в любом из вариантов осуществления 1-6, представляют собой *цис*-рацемат: фенильное кольцо с левой стороны и группа A-C(=O)-NH с правой стороны находятся в *цис*-положении по отношению друг к другу в циклобутильном кольце:



Таким образом, рацемическое соединение формулы (I) представляет собой смесь 1:1 соединений формулы (Ia) и (Ib). Клиновидные связи, показанные в соединениях формулы (Ia) и (Ib), отражают абсолютную стереохимическую конфигурацию, тогда как толстые прямые связи, такие как связи, показанные для соединений формулы (I), отражают относительную стереохимическую конфигурацию в рацемических соединениях.

Также неожиданно было обнаружено, что один энантиомер соединений формулы (I) является особенно пригодным в обеспечении контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами рода *Fusarium*, в частности *Fusarium virguliforme*.

Таким образом, в качестве варианта осуществления 7 предусмотрен способ в соответствии с вариантом осуществления 1, где соединение представлено формулой (Ia),



Специалисту в данной области техники известно, что в соответствии со способом варианта осуществления 2 соединение формулы (Ia) применяют, как правило, как часть

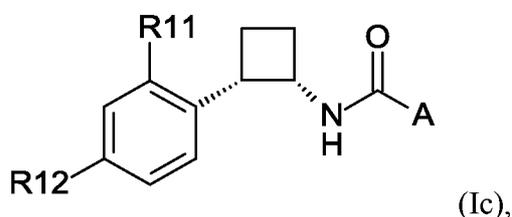
пестицидной композиции. Следовательно, в качестве варианта осуществления 8 предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами рода *Fusarium*, в частности *Fusarium virguliforme*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения пестицидной композиции, содержащей соединение в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-7 и одно или несколько вспомогательных веществ для составления. В качестве варианта осуществления 9 предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами рода *Fusarium*, в частности *Fusarium virguliforme*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения пестицидной композиции, содержащей соединение формулы (Ia) и одно или несколько вспомогательных веществ для составления. В способе в соответствии с вариантом осуществления 9 для пестицидных композиций, содержащих как соединение формулы (Ia), так и соединение формулы (Ib), соотношение соединения формулы (Ia) и его энантиомера (соединения формулы (Ib)) должно составлять больше чем 1:1. Предпочтительно соотношение соединения формулы (Ia) и соединения формулы (Ib) составляет больше чем 1,5:1, более предпочтительно больше чем 2,5:1, в особенности больше чем 4:1, преимущественно больше чем 9:1, желательно больше чем 20:1, в частности больше чем 35:1.

Смеси, содержащие не более 50%, предпочтительно не более 40%, более предпочтительно не более 30%, в особенности не более 20%, преимущественно не более 10%, желательно не более 5%, в частности не более 3% *транс*-стереоизомеров соединений формулы (I) (т. е. в которых группы В и А-С(=О)-NH находятся в *транс*-положении относительно друг друга), также следует понимать как часть данного изобретения. Предпочтительно соотношение соединения формулы (I) и его *транс*-изомера составляет больше чем 1,5:1, более предпочтительно больше чем 2,5:1, в особенности больше чем 4:1, преимущественно больше чем 9:1, желательно больше чем 20:1, в частности больше чем 35:1.

Предпочтительно в композиции, содержащей соединение формулы (Ia), его *транс*-изомер (т. е. в котором группы В и А-СО-NR₂ находятся в *транс*-положении относительно друг друга) и соединение формулы (Ib), композиция содержит

соединение формулы (Ia) в концентрации по меньшей мере 50%, более предпочтительно 70%, еще более предпочтительно 85%, в частности более 90% и особенно предпочтительно более 95%, при этом каждое значение указано относительно общего количества соединения формулы (Ia), его *транс*-изомера и соединения формулы (Ib).

Кроме того, в качестве варианта осуществления 10 предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами рода *Fusarium*, в частности *Fusarium virguliforme*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с формулой (Ic),



где

R11 и R12 независимо выбраны из галогена;

A представляет собой пиридил, который замещен одним или двумя заместителями, независимо выбранными из галогена и C₁-C₄-галогеналкила.

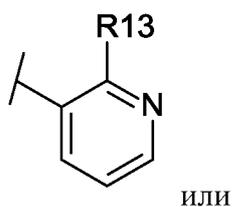
В качестве варианта осуществления 11 предусмотрен способ в соответствии с вариантом осуществления 10, где

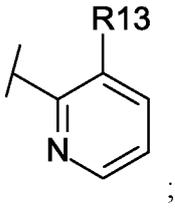
R11 и R12 независимо выбраны из хлора и фтора;

A представляет собой пирид-2-ил или пирид-3-ил, который замещен одним или двумя заместителями, представляющими собой C₁-C₄-галогеналкил.

В качестве варианта осуществления 12 предусмотрен способ в соответствии с вариантами осуществления 10 или 11, где

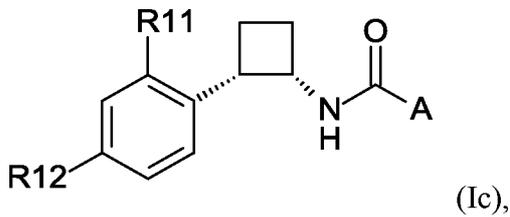
A выбран из





R13 представляет собой C₁-C₄-галогеналкил, предпочтительно трифторметил.

5 В качестве варианта осуществления 13 предусмотрен способ в соответствии с любым из вариантов осуществления 10-12, где соединение выбрано из любого из соединений 1-12 формулы (Ic),



где R11, R12 и A определены в следующей таблице:

Соединение	A	R11	R12
1	2-трифторметилпирид-3-ил	Cl	Cl
2	3-трифторметилпирид-2-ил	Cl	Cl
3	3-трифторметилпирид-2-ил	F	F
4	3-трифторметилпирид-2-ил	Cl	F
5	3-хлорпирид-2-ил	Cl	Cl
6	2-метилпирид-3-ил	Cl	Cl
7	2-трифторметилпирид-3-ил	Cl	F

10 В качестве варианта осуществления 14 предусмотрен способ в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13, включающий стадии

- обеспечения композиции, содержащей соединение, определенное в любом из вариантов осуществления 1-13;
- применения композиции по отношению к материалу для размножения;
- посадки материала для размножения.

5

В качестве варианта осуществления 15 предусмотрен способ в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13, включающий стадии

- обеспечения композиции, содержащей соединение, определенное в любом из вариантов осуществления 1-13;
- применения композиции по отношению к сельскохозяйственной культуре растений или месту их произрастания.

10

В качестве варианта осуществления 16 предусмотрено применение соединения, определенного в любом из вариантов осуществления 1-13, для контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами рода *Fusarium*.

15

В качестве варианта осуществления 17 предусмотрено применение соединения в соответствии с вариантом осуществления 16, где фитопатогенный микроорганизм представляет собой *Fusarium virguliforme*.

20

В качестве варианта осуществления 18 предусмотрен способ выращивания растений сои, включающий применение по отношению к сое или материалу для ее размножения соединения, определенного в любом из пп. 1-13, или обработку им.

25

Получение соединений, определенных в способах по любому из вариантов осуществления 1-13, было раскрыто в WO 2013/143811 и WO 2015/003951, которые включены в данный документ посредством ссылки.

30

Определения

Термин "галоген" означает фтор, хлор, бром или йод, в частности фтор, хлор или бром.

Термин "алкил" или "алк", применяемый в данном документе либо отдельно, либо как часть большей группы (такой как алкокси, алкилтио, алкоксикарбонил и

алкилкарбонил) представляет собой прямую или разветвленную цепь и представляет собой, например, метил, этил, *n*-пропил, *n*-бутил, изопропил, *втор*-бутил, изобутил, *трет*-бутил, пентил, *изо*-пентил или *n*-гексил. Алкильные группы в подходящем случае представляют собой C₁-C₄-алкильные группы.

5

"Галогеналкил", применяемый в данном документе, представляет собой алкильные группы, как определено выше, которые замещены одним или несколькими одинаковыми или различными атомами галогена и представляют собой, например, CF₃, CF₂Cl, CF₂H, CCl₂H, FCH₂, ClCH₂, BrCH₂, CH₃CHF, (CH₃)₂CF, CF₃CH₂ или CHF₂CH₂.

10

Способы и варианты применения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-18 являются предпочтительными для контроля или предупреждения заражения сельскохозяйственной культуры фитопатогенными микроорганизмами рода *Fusarium*, в частности *Fusarium Virguliforme*, включая грибы рода *Fusarium*, которые являются

15

устойчивыми к другим фунгицидам. Грибы рода *Fusarium*, которые являются "устойчивыми" к отдельным фунгицидам, относятся, например, к штаммам *Fusarium*, которые являются менее чувствительными к данному фунгициду по сравнению с ожидаемой чувствительностью тех же видов *Fusarium*. Ожидаемую чувствительность можно измерить с использованием, например, штамма, который ранее не подвергался воздействию фунгицида.

20

Применение в соответствии со способами или вариантами применения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-18 является предпочтительным в отношении сельскохозяйственной культуры растений, места их произрастания или материала для их размножения. Предпочтительно применение осуществляется по отношению к сельскохозяйственной культуре растений или материалу для их размножения, более предпочтительно к материалу для их размножения. Применение соединений по настоящему изобретению можно осуществлять в соответствии с любым из обычных способов применения, например, внекорневым, путем орошения, почвенным, путем

25

30

Соединения, определенные в любом из вариантов осуществления 1-13, предпочтительно применяются для контроля вредителей при 1-500 г/га, предпочтительно 10-70 г/га.

Соединения, определенные в любом из вариантов осуществления 1-13, являются подходящими для применения на любом растении сои, в том числе на тех, которые были генетически модифицированы с тем, чтобы быть устойчивыми к активным ингредиентам, таким как гербициды, или чтобы продуцировать биологически активные соединения, которые обеспечивают контроль заражения вредителями растений.

Как правило, соединение, определенное в любом из вариантов осуществления 1-13, применяют в форме композиции (например, состава), содержащей носитель.

Соединение, определенное в любом из вариантов осуществления 1-13, и композиции на его основе можно использовать в различных формах, таких как аэрозольный распылитель, капсульная суспензия, концентрат для образования тумана на холоде, порошок для опудривания, эмульгируемый концентрат, эмульсия "масло в воде", эмульсия "вода в масле", инкапсулированная гранула, мелкая гранула, текучий концентрат для обработки семян, газ (под давлением), образующий газ продукт, гранула, концентрат для образования тумана в тепле, макрогранула, микрогранула, диспергируемый в масле порошок, смешиваемый с маслом текучий концентрат, смешиваемая с маслом жидкость, паста, палочка для растения, порошок для сухой обработки семян, семена, покрытые пестицидом, растворимый концентрат, растворимый порошок, раствор для обработки семян, суспензионный концентрат (текучий концентрат), жидкость сверхнизкого объема (ULV), суспензия сверхнизкого объема (ULV), диспергируемые в воде гранулы или таблетки, диспергируемый в воде порошок для полусухого протравливания, растворимые в воде гранулы или таблетки, растворимый в воде порошок для обработки семян и смачиваемый порошок.

Состав, как правило, содержит жидкий или твердый носитель и необязательно одно или несколько традиционных вспомогательных средств для составления, которые могут представлять собой твердые или жидкие вспомогательные средства, например, неэпоксирированные или эпоксирированные растительные масла (например, эпоксирированное кокосовое масло, рапсовое масло или соевое масло), противовспениватели, например силиконовое масло, консерванты, глины, неорганические соединения, регуляторы вязкости, поверхностно-активное вещество, связующие вещества и/или вещества для повышения клейкости. Композиция также может дополнительно содержать удобрение, донор микроэлементов или другие

препараты, которые влияют на рост растений, а также включают комбинацию, содержащую соединение по настоящему изобретению с одним или несколькими другими биологически активными средствами, такими как бактерициды, фунгициды, нематоциды, активаторы роста растений, акарициды и инсектициды.

5

Композиции получают способом, известным *per se*, в отсутствие вспомогательных средств, например, посредством измельчения, просеивания и/или прессования твердого соединения по настоящему изобретению, и в присутствии по меньшей мере одного вспомогательного средства, например, посредством тщательного смешивания и/или

10 измельчения соединения по настоящему изобретению со вспомогательным средством (вспомогательными средствами). В случае твердых соединений по настоящему изобретению измельчение/размалывание соединений осуществляют для обеспечения конкретного размера частиц.

15

Примерами композиций для применения в сельском хозяйстве являются эмульгируемые концентраты, суспензионные концентраты, микроэмульсии, диспергируемые в масле композиции, непосредственно распыляемые или разбавляемые растворы, намазываемые пасты, разбавленные эмульсии, растворимые порошки, диспергируемые порошки, смачиваемые порошки, пылевидные препараты, гранулы

20 или инкапсулированные формы в полимерных веществах, которые содержат по меньшей мере соединение, определенное в любом из вариантов осуществления 1-13, и тип композиции следует выбирать в соответствии с предполагаемыми целями и преобладающими условиями.

25

Как правило, композиции содержат 0,1-99%, в частности, 0,1-95% соединения, определенного в любом из вариантов осуществления 1-7, и 1-99,9%, в частности, 5-99,9% по меньшей мере одного твердого или жидкого носителя, это обычно возможно, если 0-25%, в частности, 0,1-20% композиции составляют поверхностно-активные вещества (% в каждом случае означает весовой процент). Поскольку

30

концентрированные композиции обычно являются предпочтительными для коммерческих товаров, конечный потребитель, как правило, применяет разбавленные композиции, которые характеризуются существенно более низкими концентрациями активного ингредиента.

Примерами типов состава для внекорневого применения для предварительно смешанных композиций являются следующие:

- GR: гранулы
- WP: смачиваемые порошки
- 5 WG: диспергируемые в воде гранулы (порошки)
- SG: растворимые в воде гранулы
- SL: растворимые концентраты
- EC: эмульгируемый концентрат
- EW: эмульсии, "масло в воде"
- 10 ME: микроэмульсия
- SC: водный суспензионный концентрат
- CS: водная капсульная суспензия
- OD: суспензионный концентрат на основе масла и
- SE: водная суспензия.

15

При этом примерами типов состава для обработки семян для предварительно смешанных композиций являются:

- WS: смачиваемые порошки в виде взвеси для обработки семян
- LS: раствор для обработки семян
- 20 ES: эмульсии для обработки семян
- FS: суспензионный концентрат для обработки семян
- WG: диспергируемые в воде гранулы и
- CS: водная капсульная суспензия.

25 Примерами типов состава, подходящих для смешанных в баке композиций, являются растворы, разбавленные эмульсии, суспензии или их смесь и пылевидные препараты.

Как и природу составов, способы применения, такие как внекорневое применение, применение путем орошения, распыление, мелкодисперсное распыление, опыливание, 30 разбрасывание, нанесение покрытия или полив, выбирают в соответствии с предполагаемыми целями и преобладающими условиями.

Смешиваемые в баке композиции, как правило, получают путем разбавления растворителем (например, водой) одной или нескольких предварительно смешанных

композиций, содержащих различные пестициды и необязательно дополнительные вспомогательные средства.

5 Подходящие носители и вспомогательные вещества могут быть твердыми или жидкими и представляют собой вещества, обычно используемые в технологии составления, например, природные или регенерированные минеральные вещества, растворители, диспергирующие средства, смачивающие средства, вещества для повышения

10 Как правило, смешиваемый в баке состав для внекорневого или почвенного применения содержит 0,1-20%, в частности, 0,1-15% необходимых ингредиентов и 99,9-80%, в частности, 99,9-85% твердых или жидких вспомогательных средств (в том числе, например, растворитель, такой как вода), при этом вспомогательные средства могут представлять собой поверхностно-активное вещество в количестве 0-20%, в

15 частности, 0,1-15% в пересчете на количество состава баковой смеси.

Как правило, предварительно смешанный состав для внекорневого применения содержит 0,1-99,9%, в частности, 1-95% необходимых ингредиентов и 99,9-0,1%, в частности, 99-5% твердого или жидкого вспомогательного вещества (в том числе,

20 например, растворителя, такого как вода), при этом вспомогательные средства могут представлять собой поверхностно-активное вещество в количестве 0-50%, в частности, 0,5-40% в пересчете на количество предварительно смешанного состава.

Обычно смешиваемый в баке состав для применения для обработки семян содержит

25 0,25-80%, в частности, 1-75% необходимых ингредиентов и 99,75-20%, в частности, 99-25% твердых или жидких вспомогательных средств (в том числе, например, растворитель, такой как вода), при этом вспомогательные средства могут представлять собой поверхностно-активное вещество в количестве 0-40%, в частности, 0,5-30% в пересчете на количество состава баковой смеси.

30 Как правило, предварительно смешанный состав для применения для обработки семян содержит 0,5-99,9%, в частности, 1-95% необходимых ингредиентов и 99,5-0,1%, в частности, 99-5%, твердого или жидкого вспомогательного вещества (в том числе,

например, растворителя, такого как вода), при этом вспомогательные средства могут представлять собой поверхностно-активное вещество в количестве 0-50%, в частности, 0,5-40% в пересчете на количество предварительно смешанного состава.

- 5 Тогда как коммерческие продукты предпочтительно будут составлены в виде концентратов (например, предварительно смешанной композиции (состава)), конечный пользователь обычно будет использовать разбавленные составы (например, смешиваемую в баке композицию).
- 10 Предпочтительными предварительно смешанными составами для обработки семян являются водные суспензионные концентраты. Состав можно применять по отношению к семенам с использованием традиционных методик обработки и устройств, таких как методики псевдооживленного слоя, метод валковой мельницы, ротостатические протравливатели семян и барабаны для нанесения покрытий. Также
- 15 можно использовать другие способы, такие как фонтанирующие слои. Перед нанесением покрытия семена могут быть предварительно разделены по размерам. После нанесения покрытия семена, как правило, сушат, а затем переносят в сортирующую по размеру машину для сортировки по размеру. Такие процедуры известны из уровня техники. Соединения по настоящему изобретению особенно
- 20 подходят для использования при применении для обработки почвы и семян. Как правило, предварительно смешанные композиции по настоящему изобретению содержат 0,5-99,9, в частности, 1-95, преимущественно 1-50% по массе необходимых ингредиентов и 99,5-0,1, в частности, 99-5% по массе твердого или жидкого вспомогательного вещества (в том числе, например, растворителя, такого как вода), при
- 25 этом вспомогательные средства (или вспомогательного вещества) могут представлять собой поверхностно-активное вещество в количестве 0-50, в частности, 0,5-40% по массе в пересчете на массу предварительно смешанного состава.

- 30 Настоящее изобретение будет теперь проиллюстрировано следующими неограничивающими примерами. Все цитаты включены посредством ссылки.

Биологические примеры

Эффект различных видов обработки семян на сорт сои Toliman, зараженный *Fusarium virguliforme*

Обработка	Расход г а. и./100 кг	% зараженных растений	% тяжести заболевания	Сухой вес побегов в г	Длина побега в мм
Незараженная контрольная группа	0	0	0	3,81	534
Зараженная контрольная группа	0	100	100	1,04	218
Соединение 1	20	0	0	4,16	587
Соединение 1	10	28	17	3,57	505
Соединение 7	20	0	0	4,01	530
Соединение 7	10	4	1	4,09	565
Соединение 4	20	8	5	3,77	526
Соединение 4	10	8	5	3,89	541

Fusarium virguliforme / соя

- 5 x 5 семян сорта сои Toliman высевали в пластиковые горшки. В качестве субстрата использовали смесь из 50% об. песка и 50% об. стерилизованной полевой почвы. Слой
- 5 семян проса, зараженных *F. virguliforme* помещали ниже семян сои. Тестируемый объект выдерживали в камере для выращивания при 25°C с искусственным освещением в течение 14 ч; растения орошали до уровня полевой влагоемкости. В течение последних пяти дней культивирования растения выдерживали при 18°C.
- Количество зараженных растений подсчитывали на 29 день после высевания (DAS).
- 10 Оценку заболевания проводили визуально на 29 DAS путем классификации растений в соответствии со шкалой тяжести заболевания SDS, представляющую собой модификацию шкалы из Scandiani et al. (2011)* and J. Bond с использованием классов от 0 до 4. Оценивали количество растений в каждом классе. Это позволяло рассчитать "индекс SDS" путем умножения количества растений в каждом классе на степень
- 15 тяжести заболевания (0, 1, 2, 3 или 4) и добавления результатов для всех классов. Индекс SDS = $n_1 \times 0 + n_2 \times 1 + n_3 \times 2 + n_4 \times 3 + n_5 \times 4$. Индекс SDS нормализовали с получением индекса 100 для необработанного зараженного контроля (UTCINF) и

нормализованного индекса для всех видов обработки путем расчета относительно UTCINF. Сухой вес побегов и размер побегов определяли на 29 DAS.

- 5 *Scandiani M., Ruberti D., Giorda L., Pioli R., Luque A., Bottai B., Ivancovich J., Aoki T., & O'Donnell K.: Comparison of inoculation methods for characterizing relative aggressiveness of two soybean sudden-death syndrome pathogens, *Fusarium virguliforme* and *F. tucumaniae*. *Tropical Plant Pathology*, vol. 36, 3, 133-140, 2011

10 Эффект различных видов обработки семян в полевых условиях в отношении синдрома внезапной смерти (SDS), обусловленного *Fusarium virguliforme*

- 15 Полевые испытания сои проводили в Клинтоне, Иллинойс, США. На данном участке в прошлом сообщалось о возникновении SDS. В отношении семян применяли различные соединения с использованием протравливателя семян Rotostat и их высевали 31 мая 2017 года с применением 4-рядной дисковой сеялки. Заболевание возникло в конце августа, а оценку степени распространения заболевания (подсчет зараженных растений) проводили 15 сентября 2017 года. Данные об урожайности зерновых были взяты в конце сезона.

20 Перечень видов обработки – полевые испытания

Обработка	Расход АІ (мг а. и./семя)	Способ применения
1 БЕЗ ОБРАБОТКИ*	---	---
2 ФЛУОПИРАМ* (КОММЕРЧЕСКИЙ СТАНДАРТНЫЙ SDHI)*	0,15	обработка семян
3 СОЕДИНЕНИЕ 1*	0,15	обработка семян

* Все виды обработки проводили с базовой обработкой ФЛУДИОКСОНИЛОМ + МЕТАЛАКСИЛОМ-М + СЕДАКСАНОМ + ТИАМЕТОКСАМОМ в количестве 0,0038 + 0,0114 + 0,00379 + 0,076 мг а. и./семя.

Методика

Сельскохозяйственная культура	Соя
Дата посадки	31 мая 2016 года
Срок целевого применения	Обработка семян (SAF)
Применяемый объем	400 мл/100 кг
Используемое оборудование	Протравливатель семян Rotostat
Размер участка	Ширина сеялки (4-рядная), размер участка 3 м x 8 м, 24 м ² на участок
Повторности	6
Выбор участка	Известны данные о частых случаях возникновения SDS.

Оценка

Цель	Оценки
Степень распространения вредителей	Степень распространения вредителей (%) исходя из количества зараженных растений на участке
Урожайность	Общее количество урожая на участке, бушелей на акр

5 Степень распространения вредителей (%) через 107 дней после посадки

	% степени распространения заболевания, значительно различные значения (Виды обработки без общего буквенного обозначения характеризуются значительным отличием при уровне вероятности 5%)	% эффективности исходя из степени распространения заболевания Способ расчетов: $100 - (100 / (\text{необработанный} / \text{обработанный}))$
БЕЗ ОБРАБОТКИ*	60,00 А	-
ФЛУОПИРАМ* (КОММЕРЧЕСКИЙ СТАНДАРТНЫЙ SDHI)*	25,00 В	58,33
СОЕДИНЕНИЕ 1*	12,17 В	79,72

* Все виды обработки проводили с базовой обработкой ФЛУДИОКСОНИЛОМ + МЕТАЛАКСИЛОМ-М + СЕДАКСАНОМ + ТИАМЕТОКСАМОМ в количестве 0,0038 + 0,0114 + 0,00379 + 0,076 мг а. и./семя.

5 Урожайность на участке (бушель/акр) через 150 дней после посадки

	Урожайность (бушель/акр), значительно различные значения (Виды обработки без общего буквенного обозначения характеризуются значительным отличием при уровне вероятности 5%)	% увеличения урожайности Способ расчетов: урожайность обработанных растений - урожайность необработанных растений
БЕЗ ОБРАБОТКИ*	71,04 А	-
ФЛУОПИРАМ* (КОММЕРЧЕСКИЙ СТАНДАРТНЫЙ SDHI)*	68,38 А	-3,74
СОЕДИНЕНИЕ 1*	79,15 А	11,42

* Все виды обработки проводили с базовой обработкой ФЛУДИОКСОНИЛОМ + МЕТАЛАКСИЛОМ-М + СЕДАКСАНОМ + ТИАМЕТОКСАМОМ в количестве 0,0038 + 0,0114 + 0,00379 + 0,076 мг а. и./семя.

10

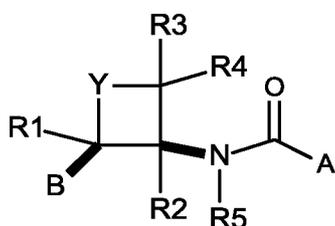
Вывод

Оба тестируемых соединения значительно уменьшили степень распространения заболевания, вызванного *Fusarium virguliforme*. Соединение 1 проявило наилучшую эффективность, равную 79,72%, затем следует соединение флуопирама (58,33).

15 Соединение 1 обеспечило увеличение урожайности на 8,11 бушелей на акр (11,42%) по сравнению с необработанным контролем. Флуопирам не обеспечил увеличение урожайности.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Способ контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами, в частности рода *Fusarium*, *sclerotinia sclerotiorum*, *microsphaera*
 5 *diffusa*, *septoria glycines* и *cercospora sojina*, более конкретно *fusarium virguliforme*,
fusarium solani, *fusarium oxysporum*, *fusarium acuminatum*, *fusarium chlamydosporum*,
fusarium compactum, *fusarium culmorum*, *fusarium equiseti*, *fusarium graminearum*,
fusarium merismoides, *fusarium proliferatum*, *fusarium pseudograminearum*, *fusarium*
 10 *semitectum*, *fusarium subglutinans* и *fusarium verticillioides*, включающий применение по
 отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или
 материалу для их размножения соединения в соответствии с формулой (I),



(I),

где

- 15 Y представляет собой O, C=O или CR₁₂R₁₃;
 A представляет собой 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, содержащее 1-3 гетероатома, каждый из которых независимо выбран из кислорода, азота и серы, или фенильное кольцо; при этом гетероароматическое кольцо или фенил необязательно замещены одним или несколькими R₆;
- 20 R₆ независимо от других представляет собой галоген, циано, C1-C4-алкил, C1-C4-галогеналкил, C1-C4-алкокси, C1-C4-галогеналкокси, C1-C4-галогеналкилтио, C1-C4-алкокси-C1-4-алкил или C1-C4-галогеналкокси-C1-C4-алкил;
- R₁, R₂, R₃, R₄, R₁₂ и R₁₃ независимо друг от друга представляют собой водород, галоген, циано, C1-C4-алкил, C1-C4-алкокси или C1-C4-галогеналкил,
- 25 R₅ представляет собой водород, метокси или гидроксил,
 B представляет собой фенил, замещенный одним или несколькими R₈,
 R₈ независимо от других представляет собой галоген, циано или группу -L-R₉, где каждый L независимо от других представляет собой связь, -O-, -OC(O)-, -NR₇-, -NR₇CO-, -NR₇S(O)_n-, -S(O)_n-, -S(O)_nNR₇-, -COO- или CONR₇-,

n равняется 0, 1 или 2,

R7 представляет собой водород, C1-C4-алкил, C1-C4-галогеналкил, бензил или фенил, где бензил и фенил являются незамещенными или замещенными галогеном, циано, C1-C4-алкилом или C1-C4-галогеналкилом;

- 5 R9 независимо от других представляет собой, C1-C6-алкил, который является незамещенным или замещенным одним или несколькими R10, C3-C6-циклоалкил, который является незамещенным или замещенным одним или несколькими R10, C6-C14-бициклоалкил, который является незамещенным или замещенным одним или несколькими R10, C2-C6-алкенил, который является незамещенным или замещенным
- 10 одним или несколькими R10, C2-C6-алкинил, который является незамещенным или замещенным одним или несколькими R10, фенил, который является незамещенным или замещенным R10, или гетероарил, который является незамещенным или замещенным одним или несколькими R10,

- R10 независимо от других представляет собой галоген, циано, C1-C4-алкил, C1-C4-галогеналкил, C1-C4-алкокси, C1-C4-галогеналкокси, C1-C4-алкилтио, C1-C4-галогеналкилтио, C3-C6-алкенилокси или C3-C6-алкинилокси;
- 15 или его соли или N-оксида;

- где B и A-CO-NR5 находятся в цис-положении по отношению друг к другу в четырехчленном кольце,
- 20 или таутомера или стереоизомера этих соединений.

2. Способ по п. 1, где

Y представляет собой O или CH₂;

- A представляет собой 6-членное гетероароматическое кольцо, содержащее 1-2 атома азота, или фенильное кольцо; при этом гетероароматическое кольцо или фенил
- 25 необязательно замещены одним или несколькими R₆;

R₆ независимо от других представляет собой галоген, циано, C1-C4-алкил, C1-C4-галогеналкил или C1-C4-галогеналкокси;

каждый из R₁, R₂, R₃, R₄ и R₅ представляет собой водород;

- 30 B представляет собой фенил, замещенный одним или несколькими R₈;

R₈ независимо от других выбран из галогена, циано, C1-C4-алкила, C1-C4-галогеналкила, C1-C4-галогеналкокси и C3-C6-циклоалкила.

3. Способ по п. 1 или п. 2, где А представляет собой 6-членное гетероароматическое кольцо, содержащее 1-2 атома азота и имеющее 1-3 заместителя, выбранных из R6, или фенильное кольцо, имеющее 1 или 3 заместителя, выбранных из R6.

5 4. Способ по любому из пп. 1-3, где
где В представляет собой фенил, замещенный 1-3 заместителями, представляющими собой R8.

10 5. Способ по любому из пп. 1-4, где В представляет собой фенил, замещенный 1-3 заместителями, независимо выбранными из фтора, хлора, трифторметила, циклопропила, дифторметокси и трифторметокси;
А представляет собой фенил, пиридил или пирозинил, кольца которых независимо друг от друга являются незамещенными или замещенными 1-3 заместителями, независимо выбранными из хлора, брома, фтора, метила, циано и трифторметила, Y представляет
15 собой O или CH₂, и каждый из R1, R2, R3, R4 и R5 представляет собой водород.

6. Способ по любому из пп. 1-5, где

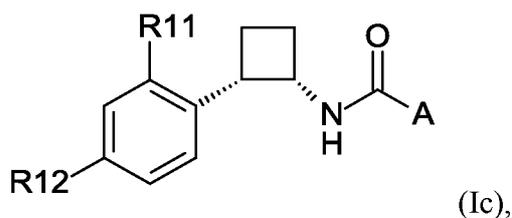
Y представляет собой CH₂;

В представляет собой моно- или дизамещенный галогеном фенил;

20 А выбран из фенила, пирозинила и пиридила, каждый из которых является моно- или дизамещенным заместителями, независимо выбранными из галогена и C1-C4-галогеналкила;

каждый из R1, R2, R3, R4 и R5 представляет собой водород.

25 7. Способ по любому из пп. 1-6, где соединение представляет собой соединение формулы (Ic),



где

30 R11 и R12 независимо выбраны из галогена;

A представляет собой пиридил, который замещен одним или двумя заместителями, независимо выбранными из галогена и C₁-C₄-галогеналкила.

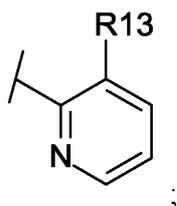
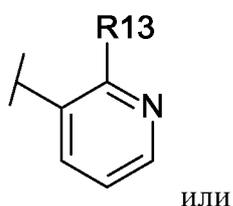
8. Способ по п. 7, где

5 R11 и R12 независимо выбраны из хлора и фтора;

A представляет собой пирид-2-ил или пирид-3-ил, который замещен одним или двумя заместителями, представляющими собой C₁-C₄-галогеналкил.

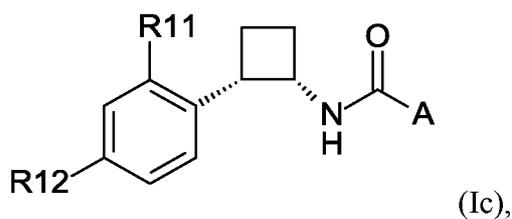
9. Способ по любому из пп. 1-3, где

10 A выбран из



R13 представляет собой C₁-C₄-галогеналкил.

15 10. Способ по п. 1, где соединение выбрано из любого из соединений 1-7 формулы (Ic),



где R11, R12 и A определены в следующей таблице:

Соединение	A	R11	R12
1	2-трифторметилпирид-3-ил	Cl	Cl
2	3-трифторметилпирид-2-ил	Cl	Cl
3	3-трифторметилпирид-2-ил	F	F

Соединение	А	R11	R12
4	3-трифторметилпирид-2-ил	Cl	F
5	3-хлорпирид-2-ил	Cl	Cl
6	2-метилпирид-3-ил	Cl	Cl
7	2-трифторметилпирид-3-ил	Cl	F

11. Способ по любому из пп. 1-10, где фитопатогенный микроорганизм представляет собой *Fusarium virguliforme*.

5 12. Применение соединения, определенного в любом из пп. 1-10, для контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами, в частности рода *Fusarium*,
sclerotinia sclerotiorum, *microsphaera diffusa*, *septoria glycines*, *cercospora sojina*,
более конкретно *fusarium virguliforme*, *fusarium solani*, *fusarium oxysporum*, *fusarium acuminatum*, *fusarium chlamydosporum*, *fusarium compactum*, *fusarium culmorum*, *fusarium equiseti*, *fusarium graminearum*, *fusarium merismoides*, *fusarium proliferatum*, *fusarium pseudograminearum*, *fusarium semitectum*, *fusarium subglutinans* и *fusarium verticilliodes*.

10 13. Применение соединения по п. 12, где фитопатогенный микроорганизм представляет собой *Fusarium virguliforme*.

14. Способ выращивания растений сои, включающий применение по отношению к сое или материалу для ее размножения соединения, определенного в любом из пп. 1-10, или обработку им.