

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(11) 041244

(13) B1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ

(45) Дата публикации и выдачи патента
2022.09.29

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

(21) Номер заявки
202090434

(22) Дата подачи заявки
2018.08.08

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

(31) 17185509.1; 17202349.1

(56) WO-A1-2016066644

(32) 2017.08.09; 2017.11.17

WO-A1-2013143811

(33) EP

WO-A1-2015003951

(43) 2020.07.31

US-A1-2015223457

(86) PCT/EP2018/071558

US-A1-2016075653

(87) WO 2019/030307 2019.02.14

WO-A1-2017207362

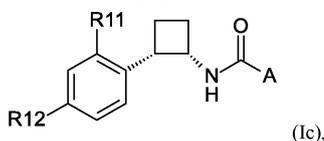
WO-A1-2018114657

(71)(73) Заявитель и патентовладелец:
ЗИНГЕНТА ПАРТИСИПЕЙШНС АГ
(CH)

(72) Изобретатель:
Габертюэль Маттиас (CH)

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

(57) Настоящее изобретение относится к способам контроля или предупреждения заражения сои фитопатогенным микроорганизмом рода *Fusarium virguliforme*, включающим применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с формулой (Ic)



где R11, R12 и A определены в данном документе. Настоящее изобретение также относится к применению соединения, указанного соединения, для контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенным микроорганизмом рода *Fusarium virguliforme*.

B1

041244

041244

B1

Область техники

Настоящее изобретение относится к способам контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами рода *Fusarium virguliforme*.

Уровень техники

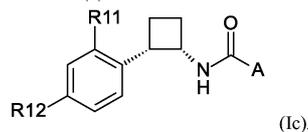
Синдром внезапной смерти (SDS) является одним из главных заболеваний, вызывающих снижение урожайности соевых бобов, особенно в США. За последние пять лет среднегодовой ущерб, обусловленный SDS, составлял для производителей сои более 44 млн бушелей потерянного урожая, и при этом распространение заболевания 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 контроля или предупреждения заражения данным вредителем и другими вредителями, такими как стволовая гниль, вызванная склеротинией (белая гниль), милдью, септория, селенофомозная пятнистость листьев у сои.

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

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

Следовательно, в качестве варианта осуществления 1 предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами рода *Fusarium virguliforme*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с формулой (Ic)

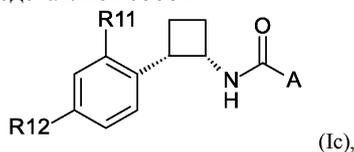


где R11, R12 и A определены в следующей таблице:

Соединение	A	R11	R12
1	2-трифторметилпирид-3-ил	Cl	Cl
4	3-трифторметилпирид-2-ил	Cl	F
7	2-трифторметилпирид-3-ил	Cl	F

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, соединение формулы (Ic) представляет собой



где R11, R12 и A определены в следующей таблице:

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

Специалисту в данной области техники известно, что в соответствии со способом варианта осуществления 2 соединение формулы (Ic) применяют, как правило, как часть пестицидной композиции. Следовательно, в качестве варианта осуществления 3 предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами рода *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 1-2 и одно или несколько вспомогательных веществ для составления.

В качестве варианта осуществления 4 предусмотрен способ в соответствии с любым из вариантов

осуществления 1-3, включающий стадии:

обеспечение композиции, содержащей соединение, определенное в любом из вариантов осуществления 1-3;

применение композиции по отношению к материалу для размножения;

посадка материала для размножения.

В качестве варианта осуществления 5 предусмотрен способ в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-3, включающий стадии:

обеспечение композиции, содержащей соединение, определенное в любом из вариантов осуществления 1-3;

применение композиции по отношению к сельскохозяйственной культуре растений или месту их произрастания.

В качестве варианта осуществления 6 предусмотрено применение соединения, определенного в любом из вариантов осуществления 1-3, для контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами рода *Fusarium virguliforme*.

Получение соединений, определенных в способах по любому из вариантов осуществления 1-3, было раскрыто в WO 2013/143811 и WO 2015/003951, которые включены в данный документ посредством ссылки.

Определения

Способы и варианты применения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-6 применяются для контроля или предупреждения заражения сельскохозяйственной культуры фитопатогенными микроорганизмами рода *Fusarium Virguliforme*, включая грибы рода *Fusarium*, которые являются устойчивыми к другим фунгицидам. Грибы рода *Fusarium*, которые являются "устойчивыми" к отдельным фунгицидам, относятся 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.

Применение в соответствии со способами или вариантами применения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-6 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 внесения в борозду и т.д.

Соединения, определенные в любом из вариантов осуществления 1-3, предпочтительно применяются для контроля вредителей при 1-500 г/га, предпочтительно 10-70 г/га.

Соединения, определенные в любом из вариантов осуществления 1-3, 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 1-3, применяют в форме композиции (например, состава), содержащей носитель. Соединение, определенное в любом из вариантов осуществления 1-3, 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.

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 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.

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 или инкапсулированные формы в полимерных веществах, которые содержат по меньшей мере соединение, определенное в любом из вариантов осуществления 1-3, и тип композиции следует выбирать в соответствии с предполагаемыми целями и преобладающими условиями.

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

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,
- ES: эмульсии для обработки семян,
- FS: суспензионный концентрат для обработки семян,
- WG: диспергируемые в воде гранулы и
- CS: водная капсульная суспензия.

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, 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.

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 клейкости, загустители, связующие вещества или удобрения.

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 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, 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 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.

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.

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).

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 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 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 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.

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.

5×5 семян сорта сои Toliman высевали в пластиковые горшки. В качестве субстрата использовали смесь из 50 об.% песка и 50 об.% стерилизованной полевой почвы. Слой 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). 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 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.

*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.

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

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.

Перечень видов обработки - полевые испытания

Обработка	Расход АИ (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 флудиоксонилем + металаксилем-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

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 флудиоксонилем + металаксилем-М + седаксаном + тиаметоксамом в количестве 0,0038 + 0,0114 + 0,00379 + 0,076 мг а.и./семя

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: $\frac{\text{урожайность обработанных растений} - \text{урожайность необработанных растений}}{\text{урожайность необработанных растений}}$
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 флудиоксонилем + металаксилем-М + седаксаном + тиаметоксамом в количестве 0,0038 + 0,0114 + 0,00379 + 0,076 мг а.и./семя

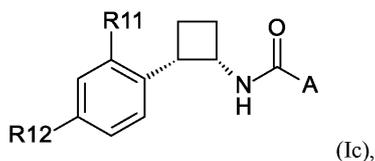
Вывод

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).

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

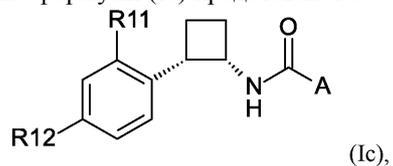
1. Способ контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенным микроорганизмом рода *Fusarium virguliforme*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с формулой (Ic)



где R11, R12 и A определены в следующей таблице:

Соединение	A	R11	R12
1	2-трифторметилпирид-3-ил	Cl	Cl
4	3-трифторметилпирид-2-ил	Cl	F
7	2-трифторметилпирид-3-ил	Cl	F

2. Способ по п.1, где соединение формулы (Ic) представляет собой



где R11, R12 и A определены в следующей таблице:

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

3. Применение соединения, определенного в любом из пп.1, 2, для контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенным микроорганизмом рода *Fusarium virguliforme*.

