

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(11) **045411**

(13) **B1**

(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ**

(45) Дата публикации и выдачи патента
2023.11.23

(51) Int. Cl. *A01N 43/40* (2006.01)
A01N 25/00 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)

(21) Номер заявки
202191996

(22) Дата подачи заявки
2020.01.20

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

(31) **19153247.2**

(56) WO-A1-2013143811
WO-A1-2015003951
GB-A-2521255
WO-A2-2008135480
WO-A1-2019030307

(32) **2019.01.23**

(33) **EP**

(43) **2022.01.28**

(86) **PCT/EP2020/051309**

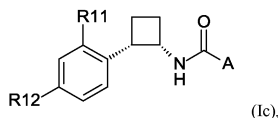
(87) **WO 2020/152116 2020.07.30**

(71)(73) Заявитель и патентовладелец:
**СИНГЕНТА КРОП ПРОТЕКШН АГ
(CH)**

(72) Изобретатель:
Габертюэль Маттиас (CH)

(74) Представитель:
**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)**

(57) Изобретение относится к способам контроля или предупреждения заражения сои фитопатогенными микроорганизмами семейства *Coynespora cassicola*, 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, A определены в данном документе.

B1

045411

045411

B1

Область техники

Настоящее изобретение относится к способам контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами семейства *Corynesporascaceae*, в частности *Corynespora cassiicola*, семейства *Fusarium*, в частности *Fusarium pallidoroseum*, *tucumaniae*, *brasiliense*, *crassistipitatum*, *Cercospora kikuchi*, *Colletotrichum truncatum* и *Phomopsis sojae*.

Уровень техники

Corynespora cassiicola представляет собой грибок, который заражает более 500 растений, в частности растения сои. Данный патоген обуславливает низкую урожайность, приводя к высокому показателю экономических потерь в более чем 70 странах. Заболевание, вызываемое *Corynespora cassiicola*, называется мишеневидная пятнистость.

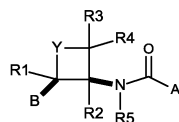
Таким образом, настоящее изобретение предусматривает дополнительные способы контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами семейства *Corynesporascaceae*, в частности *Corynespora cassiicola*. Кроме того, настоящее изобретение предусматривает дополнительные способы контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами семейства *Fusarium*, в частности *Fusarium pallidoroseum*, *tucumaniae*, *brasiliense*, *crassistipitatum*, *Cercospora kikuchi*, *Phakopsora pachyrhizi* и *Phomopsis sojae*.

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 семейства *Corynesporascaceae*, в частности *Corynespora cassiicola*. Кроме того, соединения, раскрытые в WO 2013/143811 и/или WO 2015/003951, являются эффективными для контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами, такими как организмы семейства *Fusarium*, в частности *Fusarium pallidoroseum*, *tucumaniae*, *brasiliense*, *crassistipitatum*, *Cercospora kikuchi*, *Phakopsora pachyrhizi* и *Phomopsis sojae*.

Такие высокоэффективные соединения, таким образом, представляет собой важное новое решение для фермеров в отношении контроля или предупреждения заражения растений сои грибами семейства *Corynesporascaceae*.

Следовательно, как вариант осуществления 1 предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами семейства *Corynesporascaceae*, в частности *Corynespora cassiicola*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с формулой (I)



(I),

где 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 фенильное кольцо 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-алкокси-C₁-C₄-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;

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, который является незамещенным или замещенным одним или несколькими R¹⁰, C₆-C₁₄-бициклоалкил, который является незамещенным или замещенным одним или несколькими R¹⁰, C₂-C₆-алкил, который является незамещенным или заме-

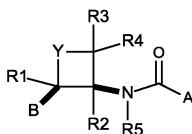
шенным одним или несколькими R10, C₂-C₆-алкинил, который является незамещенным или замещенным одним или несколькими R10, фенил, который является незамещенным или замещенным R10, или гетероарил, который является незамещенным или замещенным одним или несколькими R10;

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;

или его соли или N-оксида;

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

Следовательно, как вариант осуществления 1.1 предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами семейства *Corynesporascaceae*, в частности *Corynespora cassiicola*, семейства *Fusarium*, в частности *Fusarium pallidoroseum*, *tucumanaiae*, *brasiliense*, *crassistipitatum*, *Cercospora kikuchi* и *Phomopsis sojae*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с формулой (I)



(I),

где 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 фенильное кольцо 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-алкокси-C₁-C₄-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;

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, 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 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;

или его соли или N-оксида;

где В и А-CO-NR5 находятся в цис-положении по отношению друг к другу в четырехчленном кольце;

или таутомера или стереоизомера этих соединений.

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:

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 фенильное кольцо 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;

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.

В качестве варианта осуществления 3 предусмотрен способ в соответствии с вариантом осуществления 1 или вариантом осуществления 2, где A 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.

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

В качестве варианта осуществления 5 предусмотрен способ в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-4, где B представляет собой фенил, замещенный 1-3 заместителями, независимо выбранными из фтора, хлора, трифторметила, циклопропила, дифторметокси и трифторметокси;

A 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.

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

Y представляет собой CH₂;

B представляет собой моно- или дизамещенный галогеном фенил;

A 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.

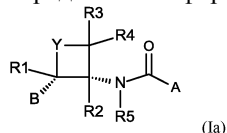
Соединения формулы (I), раскрытые в любом из вариантов осуществления 1-6, представляют собой цис-рацемат: фенильное кольцо с левой стороны и группа A-C(=O)-NH с правой стороны находятся в цис-положении по отношению друг к другу в циклобутильном кольце



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 семейства *Corynesporascaceae*, в частности *Corynespora cassiicola*.

Таким образом, как вариант осуществления 7 предусмотрен способ в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-6, где соединение представлено формулой (Ia)



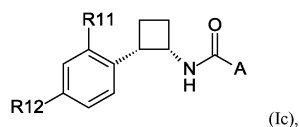
Специалисту в данной области техники известно, что в соответствии со способом варианта осуществления 2 соединение формулы (Ia) применяют, как правило, как часть пестицидной композиции. Следовательно, как вариант осуществления 8 предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами семейства *Corynesporascaceae*, в частности *Corynespora cassiicola*, 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. Как вариант осуществления 9 предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами семейства *Corynesporascaceae*, в частности *Corynespora cassiicola*, 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-C(=O)-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 соединения формулы (Ia), его транс-изомер (т.е. в котором группы В и А-CO-NR2 находятся в транс-положении относительно друг друга) и соединения формулы (Ib), композиция содержит соединения 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, как вариант осуществления 10 предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами семейства *Coynespogascaseae*, в частности *Coynespora cassicola*, 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;

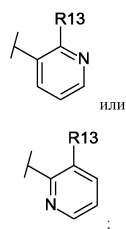
А представляет собой пиридил, который замещен одним или двумя заместителями, независимо выбранными из галогена и C₁-C₄-галогеналкила.

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

R11 и R12 независимо выбраны из хлора и фтора;

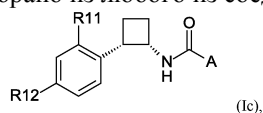
А представляет собой пирид-2-ил или пирид-3-ил, который замещен одним или двумя заместителями, представляющими собой C₁-C₄-галогеналкил.

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



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

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 А 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

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.

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.

Как вариант осуществления 16 предусмотрено применение соединения, определенного в любом из вариантов осуществления 1-13, для контроля или предупреждения заражения растений сои фитопатогенными микроорганизмами семейства *Corynesporascaceae*, в частности *Corynespora cassiicola*.

Как вариант осуществления 17, предусмотрено применение соединения в соответствии с вариантом осуществления 16, где фитопатогенный микроорганизм представляет собой *Corynespora cassiicola*.

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 вариантов осуществления 1-13, или обработку им.

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.

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, н-пропил, н-бутил, изопропил, втор-бутил, изобутил, трет-бутил, пентил, изо-пентил или н-гексил. Алкильные группы в подходящем случае представляют собой C₁-C₄-алкильные группы.

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

Способы и варианты применения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-18 являются предпочтительными для контроля или предупреждения заражения сельскохозяйственной культуры фитопатогенными микроорганизмами семейства *Corynesporascaceae*, в частности *Corynespora cassiicola*, включая грибы *Corynespora cassiicola*, которые являются устойчивыми к другим фунгицидам. Грибы семейства *Corynesporascaceae*, которые являются "устойчивыми" к отдельному фунгициду, относятся, например, к штаммам грибов семейства *Corynesporascaceae*, которые являются менее чувствительными к данному фунгициду по сравнению с ожидаемой чувствительностью тех же видов грибов семейства *Corynesporascaceae*. 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 1-18 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 внесения в борозду и т.д.

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), противопениватели, 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 содержат комбинацию, содержащую соединение по настоящему изобретению с одним или несколькими другими биологически активными средствами, такими как бактерициды, фунгициды, нематоциды, активаторы 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 1-13, 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 1-13, и 1-99,9%, в частности 5-99,9%, по меньшей мере одного твердого или жидкого носителя, это возможно, если 0-25%, в частности 0,1-20%, композиции составляют поверхностно-активные вещества (% в каждом случае означает процент по весу). 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.

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.

Кроме того, предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений картофеля фитопатогенным микроорганизмом *Alternaria alternata fusarium sambucinum*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13. Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения видов фасоли фитопатогенным микроорганизмом *Sclerotium Rolfsii*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13. Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений рапса фитопатогенным микроорганизмом *Leptosphaeria maculans*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13. Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений целозии фитопатогенным микроорганизмом *Botrytis cinerea*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13.

Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений кофейного дерева фитопатогенным микроорганизмом *Cercospora coffeicola*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13. Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений хлопчатника фитопатогенными микроорганизмами, выбранными из *Corynespora cassicola*, *Fusarium sp.*, *Ramularia areola*, *Thanatephorus cucumeris*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13. Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений огурца фитопатогенными микроорганизмами, выбранными из *COLLETOTRICHUM LAGENARIUM*; *ERYSIPHE CICHORACEARUM*; *PSEUDOPERONOSPORA CUBENSIS*, *SPHAEROTHECA SP.* и *Fusarium sp.*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13. Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений тыквы фитопатогенными микроорганизмами, выбранными из *ALTERNARIA ALTERNATA*; *DIDYMELLA BRYONIAE* и *SPHAEROTHECA FULIGINEA*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13. Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений тыквы фитопатогенными микроорганизмами, выбранными из *SCLEROTINIA MINOR* и *SCLEROTINIA SCLEROTIORUM*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13. Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений дыни фитопатогенным микроорганизмом *FUSARIUM OXYSPORUM F.MELONIS*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13. Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений окры фитопатогенным микроорганизмом *FUSARIUM OXYSPORUM F. SP. APII*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13. Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений лука фитопатогенным микроорганизмом *BOTRYTIS SP.*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13. Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения декоративных растений фитопатогенными микроорганизмами, выбранными из *ALTERNARIA SP.* и *RHIZOCTONIA SOLANI*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13. Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений перца фитопатогенным микроорганизмом *Leveillula taurica*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13. Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений петунии фитопатогенным микроорганизмом *ERYSIPHE CICHORACEARUM*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13. Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений картофеля фитопатогенным микроорганизмом *ALTERNARIA ALTERNATA FUSARIUM SAMBUCINUM*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной

ной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13. Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений тыквы фитопатогенными микроорганизмами, выбранными из *Erysiphe spp* и *SPHAEROTHECA FULIGINEA*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13. Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений томата фитопатогенными микроорганизмами, выбранными из *Alternaria solani*, *FUSARIUM OXYSPORUM F.LYCOPERSICI*, *OIDIOPSIS TAURICA*; *PHYTOPHTHORA INFESTANS* и *RYTHIUM APHANIDERMATUM*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13. Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений арбуза фитопатогенными микроорганизмами, выбранными из *DIDYMELLA BRYONIAE*, *FUSARIUM OXYSPORUM F. SP. NIVEUM*, *FUSARIUM OXYSPORUM* и *SPHAEROTHECA FULIGINEA*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13. Предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения растений тыквы обыкновенной фитопатогенным микроорганизмом *SPHAEROTHECA FULIGINEA*, включающий применение по отношению к сельскохозяйственной культуре растений, месту их произрастания или материалу для их размножения соединения в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13.

Биологические примеры.

Эффект обработки разными фунгицидами в отношении *Corynespora cassiicola* Полевые испытания сои проводили в Ричленде, Луизиана, США, для оценки эффективности разных соединений против мишеневидной пятнистости, вызванной *Corynespora cassiicola*. Семена обрабатывали разными соединениями для обработки семян и высевали 9 июня. Мишеневидная пятнистость проявлялась в середине сентября и оценку тяжести заболевания и дефолиации сельскохозяйственных культур проводили 14 сентября.

Подробности испытания.

	<u>Испытание</u>	<u>Посев</u>	<u>Сорт</u>	<u>Статус устойчивости</u>
	<u>Место проведения</u>			
1	Ричленд/Луизиана	9 июня 2018 г.	S52-Y7X	Восприимчивость

Перечень обработок - проведенные полевые испытания.

Обработка	Расход AI (мг а. и./семя)	Способ применения
1 Без обработки	---	---
2 СОЕДИНЕНИЕ 1 (FS 500)	0,075	Обработка семян
3 СОЕДИНЕНИЕ 1 (FS 500)	0,15	Обработка семян
4 Коммерческий стандарт: ингибитор сукцинатдегидрогеназы (FS 500)	0,075	Обработка семян

Сельскохозяйственные культуры и целевые заболевания в испытании.

	Латинское название	Традиционное название
Цель	CORYNESPORA CASSIICOLA	МИШЕНЕВИДНАЯ ПЯТНИСТОСТЬ
Сельскохозяйственная культура	GLYCINE MAX	СОЯ

Описание сельскохозяйственной культуры.

Испытуемая сельскохозяйственная культура	СОЯ
Сорт	S52-Y7X
Дата высаживания или посадки	09/06/2018

Схема испытания.

Условия испытания (способ испытания)	Полевое испытание
Схема эксперимента	РАНДОМИЗИРОВАННЫЙ ПОЛНЫЙ БЛОК
Размер участка	19 м ²
Количество повторностей	4

Подробности внесения.

Дата внесения	09/06/2018
Тип оборудования для внесения	Барабан для обработки семян
Объем взвеси	400 мл/100 кг семян
Используемые обработки	2, 3, 4

Оценки.

Тяжесть поражения вредителями через 97 дней после посадки.

Обработка	Расход АI (мг а. и./семя)	Тяжесть поражения вредителями (%), значимое отличие (Виды обработки без общего буквенного обозначения характеризуются значительным отличием при уровне вероятности 5%)	% эффективности исходя из тяжести поражения вредителями
1 БЕЗ ОБРАБОТКИ	--	51,25, А	0,00
2 СОЕДИНЕНИЕ 1	0,075	25,00, ВС	51,22
3 СОЕДИНЕНИЕ 1	0,15	13,25, С	73,13
4 Коммерческий стандарт: ингибитор сукцинатдегидрогеназы (FS 500)	0,075	47,50, А	7,32

Дефолиация, 97 дней после посадки.

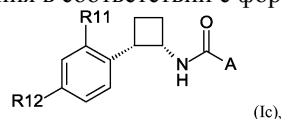
Обработка	Расход АI (мг а. и./семя)	Дефолиация (% площади), значимое отличие (Виды обработки без общего буквенного обозначения характеризуются значительным отличием при уровне вероятности 5%)	% эффективности на основе дефолиации
1 БЕЗ ОБРАБОТКИ	--	17,5, А	0,00
2 СОЕДИНЕНИЕ 1	0,075	6,25, А	64,29
3 СОЕДИНЕНИЕ 1	0,15	5, А	71,43
4 Коммерческий стандарт: ингибитор сукцинатдегидрогеназы (FS 500)	0,075	15, А	14,28

Вывод.

Соединение 1 показало высокую активность (73%) против *Corynespora cassiicola* в сое в течение 97 дней после посадки. Эффективность соединения 2 была очень низкой в отношении контроля мишеневидной пятнистости (7,3%). Обе нормы соединения 1 также обеспечили высокий уровень подавления мишеневидной пятнистости и меньший уровень дефолиации, чем соединение 2.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Способ контроля или предупреждения заражения растений сои *Corynespora cassiicola*, 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;

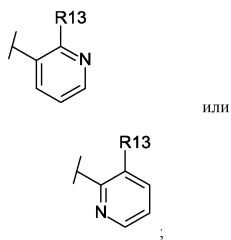
A представляет собой пиридил, который замещен одним или двумя заместителями, независимо выбранными из галогена и C₁-C₄-галогеналкила.

2. Способ по п.1, где

R11 и R12 независимо выбраны из хлора и фтора;

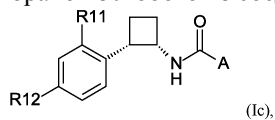
A представляет собой пирид-2-ил или пирид-3-ил, который замещен одним или двумя заместителями, представляющими собой C₁-C₄-галогеналкил.

3. Способ по любому из пп.1, 2, где A выбран из



R13 представляет собой C₁-C₄-галогеналкил.

4. 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
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

5. Применение соединения, определенного в любом из пп.1-4, для контроля или предупреждения заражения растений сои *Glycinespora cassiicola*.

