

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 202293082 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2023.02.16(22) Дата подачи заявки
2021.04.19(51) Int. Cl. A01N 37/22 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01N 43/80 (2006.01)
A01P 21/00 (2006.01)

(54) УЛУЧШЕНИЕ СЕЛЬСКОХОЗЯЙСТВЕННЫХ КУЛЬТУР

(31) 20172180.0; 20197626.3

(32) 2020.04.29; 2020.09.23

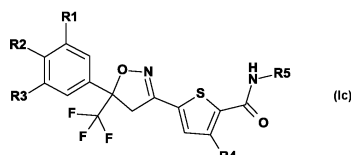
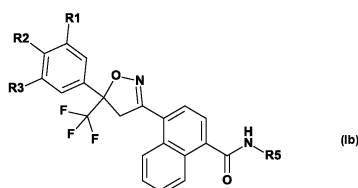
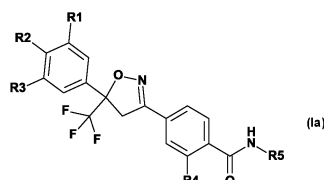
(33) EP

(86) PCT/EP2021/060106

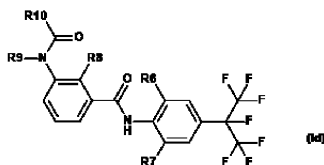
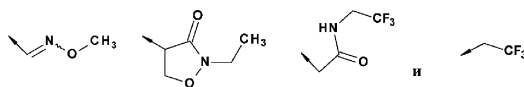
(87) WO 2021/219423 2021.11.04

(71) Заявитель:
СИНГЕНТА КРОП ПРОТЕКШН АГ
(CH)(72) Изобретатель:
Скиллмэн Стивен Уилсон, Эль
Касеми Мирием (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 способу улучшения сельскохозяйственной культуры путем применения по отношению к растениям, частям растений, материалу для размножения растений или к месту произрастания растений соединения формулы (I), которое представляет собой соединение формулы (Ia), (Ib), (Ic), (Id), (Ie) или (If)



где каждый из R1, R2 и R3 независимо выбран из H, Cl, F, Br и CF₃; каждый R4 независимо выбран из CH₃, Cl, Br и CF₃ и каждый R5 независимо выбран из



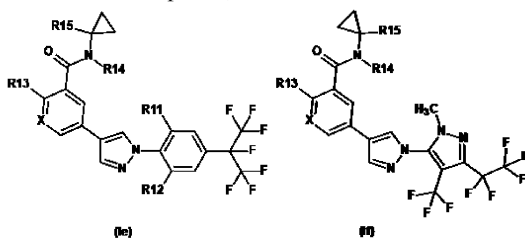
A1

202293082

202293082

A1

где каждый из R6 и R7 выбран из Cl, Br, CH₃, CH₂CH₃, CF₃ и OCF₂H; R8 выбран из F и OCH₃; R9 выбран из H, CH₃ и CH₂CH₃ и R10 представляет собой фенил, необязательно замещенный F или Cl;



где каждый из R11 и R12 выбран из Cl, Br, CH₃, CH₂CH₃, CF₃ и OCF₂H; каждый R13 независимо выбран из Cl и Br; каждый R14 независимо выбран из H, CH₃ и CH₂CH₃; каждый R15 независимо выбран из H и CN и каждый X независимо выбран из CH и N; или композиции, содержащей соединение формулы (I).

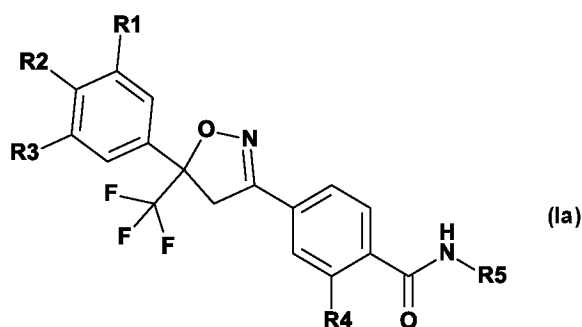
УЛУЧШЕНИЕ СЕЛЬСКОХОЗЯЙСТВЕННЫХ КУЛЬТУР

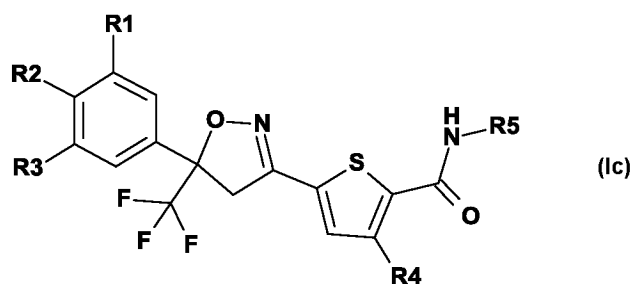
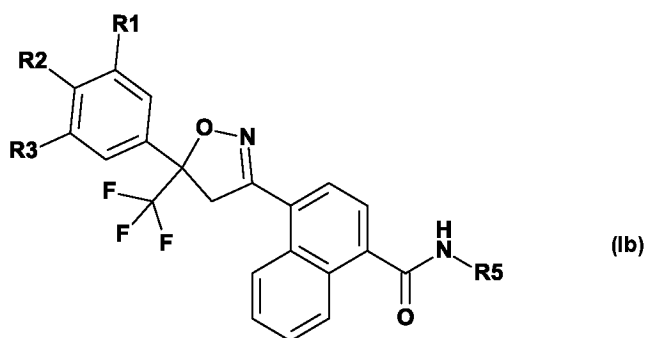
Настоящее изобретение относится к способу улучшения сельскохозяйственных культур, в частности к способу улучшения растений, относящихся к сельскохозяйственным культурам, путем применения по отношению к растениям, частям растений, материалу для размножения растений или к месту произрастания растений соединения формулы (I) и к применению указанного соединения для улучшения сельскохозяйственных культур.

Некоторые способы улучшения сельскохозяйственных культур описаны в литературе. Эти способы обычно основаны на традиционном внесении удобрений, но некоторые также основаны на применении химических веществ, изначально разработанных для других вариантов применения, например, сообщалось об инсектициде фипронице, например, для улучшения общей корневой системы и развития корневых волосков, увеличения числа побегов и продуктивности, увеличения фотосинтетической способности (зелености растений), увеличения площади листьев и высоты растений, а также стимуляции раннего цветения и созревания зерна, и фунгицид пираклостробин, как сообщается, улучшает здоровье растений, например, повышает устойчивость к стрессам окружающей среды.

Настоящее изобретение предусматривает способ улучшения сельскохозяйственной культуры путем применения по отношению к растениям, частям растений, материалу для размножения растений или к месту произрастания растений соединения формулы (I),

которое представляет собой соединение формулы (Ia), (Ib), (Ic), (Id), (Ie) или (If):

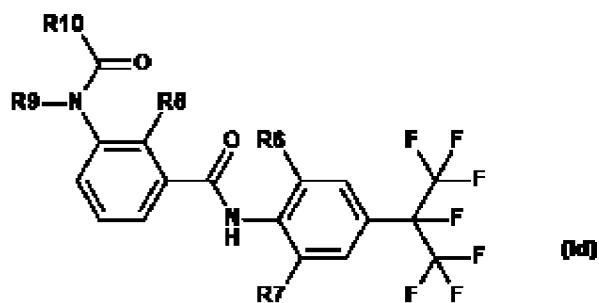
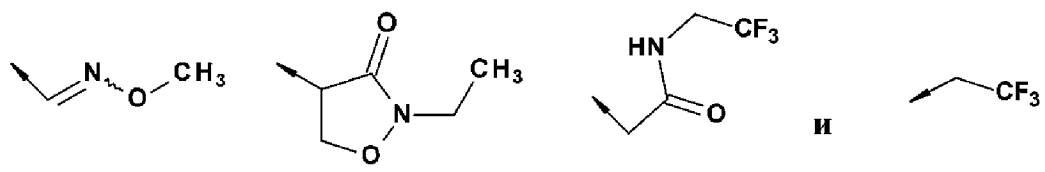




где каждый из R_1 , R_2 и R_3 независимо выбран из H, Cl, F, Br и CF_3 ;

каждый R_4 независимо выбран из CH_3 , Cl, Br и CF_3 ; и

5 каждый R_5 независимо выбран из

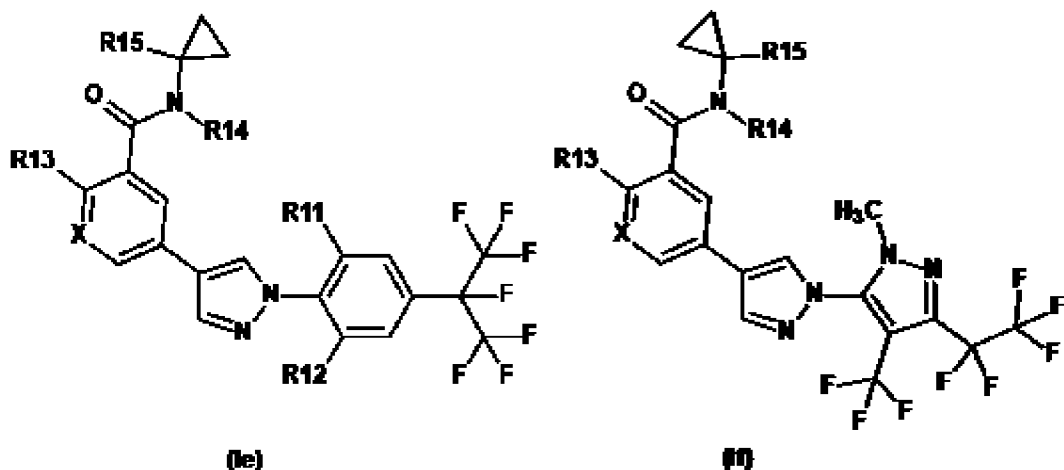


где каждый из R_6 и R_7 независимо выбран из Cl, Br, CH_3 , CH_2CH_3 , CF_3 и OCF_2H ;

R_8 выбран из F и OCH_3 ;

10 R_9 выбран из H, CH_3 и CH_2CH_3 ; и

R_{10} представляет собой фенил, необязательно замещенный F или Cl;



где каждый из R_{11} и R_{12} независимо выбран из Cl, Br, CH_3 , CH_2CH_3 , CF_3 и OCF_2H ;

каждый R_{13} независимо выбран из Cl и Br;

каждый R_{14} независимо выбран из H, CH_3 и CH_2CH_3 ;

5 каждый R_{15} независимо выбран из H и CN; и

каждый X независимо выбран из CH и N;

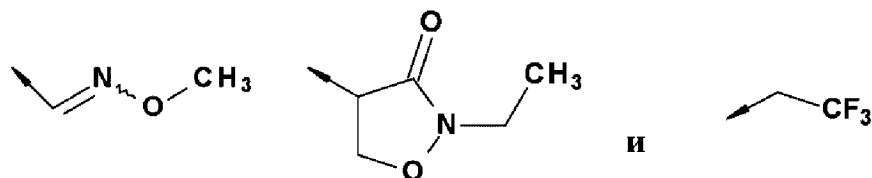
или композицию, содержащую соединение формулы (I).

Соответствующим образом, если соединение формулы (I) представляет собой

соединение формулы (Ia), каждый из R_1 , R_2 и R_3 независимо выбран из H, Cl и F;

10 R_4 представляет собой CH_3 ; и

R_5 выбран из



Более соответствующим образом, если соединение формулы (I) представляет собой
соединение формулы (Ia), каждый из R_1 , R_2 и R_3 независимо выбран из Cl и F.

15

Соответствующим образом, если соединение формулы (I) представляет собой

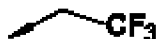
соединение формулы (Ib), каждый из R_1 , R_2 и R_3 независимо выбран из H, Cl и CF_3 ; и

R_5 представляет собой.



20 Соответствующим образом, если соединение формулы (I) представляет собой
соединение формулы (Ic), каждый из R_1 , R_2 и R_3 независимо выбран из Cl и F;

и R_5 представляет собой.



Более соответствующим образом, если соединение формулы (I) представляет собой соединение формулы (Ic), каждый из R_1 , R_2 и R_3 представляет собой Cl.

Соответствующим образом, если соединение формулы (I) представляет собой

5 соединение формулы (Id), каждый из R_6 и R_7 независимо выбран из Cl, Br и CF_3 ;

R_8 представляет собой F;

R_9 представляет собой CH_3 ; и

R_{10} представляет собой фенил.

Более соответствующим образом, если соединение формулы (I) представляет собой

10 соединение формулы (Id), R_6 и R_7 независимо выбраны из Br и CF_3 .

Соответствующим образом, если соединение формулы (I) представляет собой

соединение формулы (Ie), каждый из R_{11} и R_{12} независимо выбран из Cl и Br;

R_{13} представляет собой Cl;

15 R_{14} представляет собой CH_3 или CH_2CH_3 ;

R_{15} представляет собой H; и

X представляет собой N.

Более соответствующим образом, если соединение формулы (I) представляет собой соединение формулы (Ie), R_{11} и R_{12} одновременно представляют собой Cl.

20 Соответствующим образом, если соединение формулы (I) представляет собой

соединение формулы (If), R_{13} представляет собой Cl;

R_{14} представляет собой H или CH_3 ;

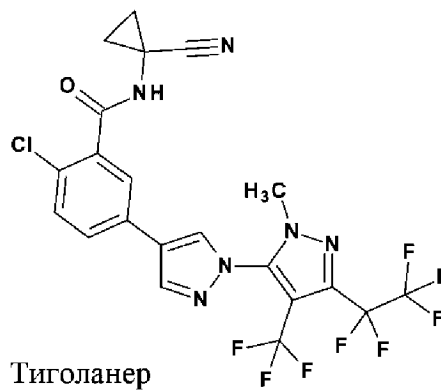
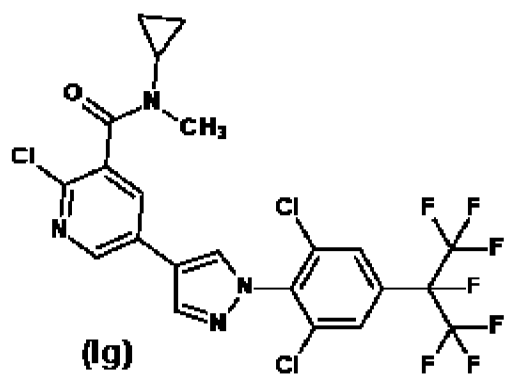
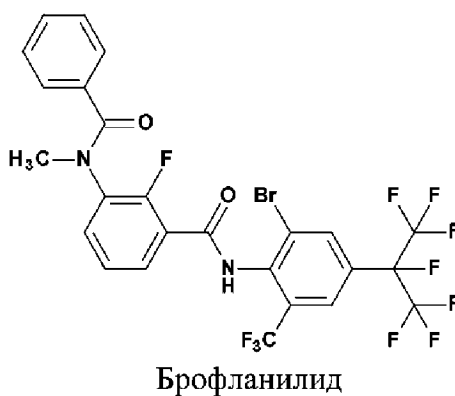
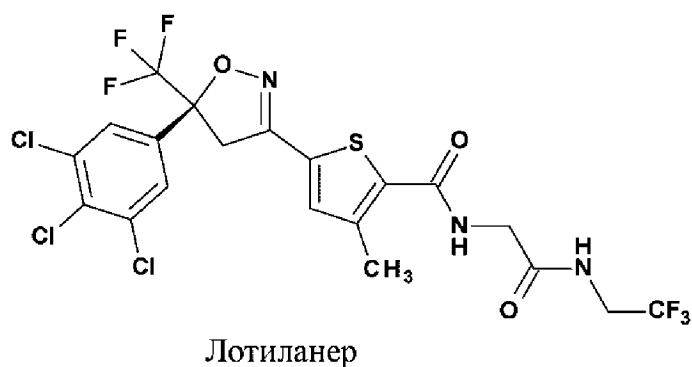
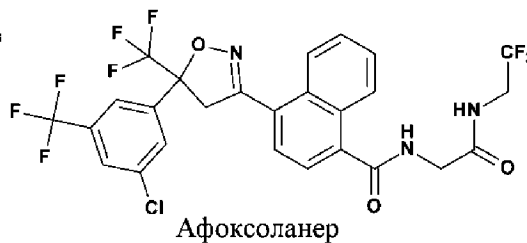
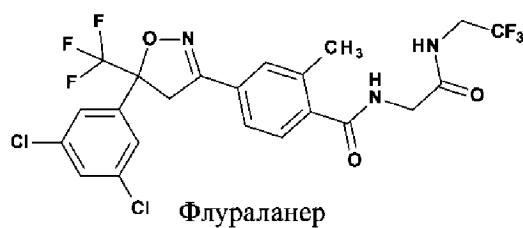
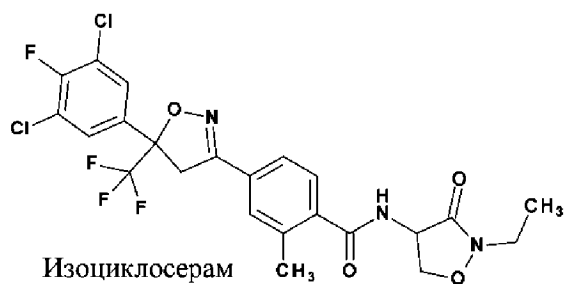
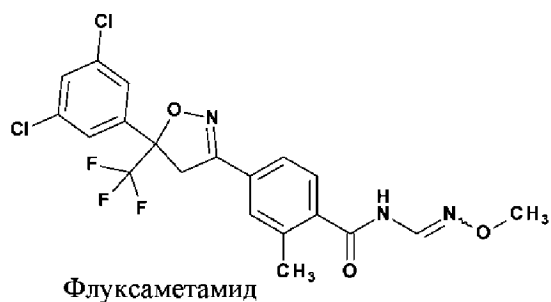
R_{15} представляет собой CN; и

X представляет собой CH.

25 Более соответствующим образом, если соединение формулы (I) представляет собой

соединение формулы (If), R_{14} представляет собой H.

Еще более соответствующим образом соединение формулы (I) выбрано из флуksamетамиды, изоциклосоxамы, флуxаланеры, афоксоланеры, лотиланеры, бpофланилиды, тиголанеры и соединения (Ig).



5 Наиболее соответствующим образом соединение формулы (I) представляет собой изоциклосерам.

Настоящее изобретение также предусматривает применение соединения формулы (I) или композиции, содержащей соединение формулы (I), для улучшения сельскохозяйственной культуры.

10 Настоящее изобретение охватывает любые изомеры и их смеси в любом соотношении.

«Улучшение сельскохозяйственных культур» или «улучшенные сельскохозяйственные культуры» в соответствии с настоящим изобретением означает улучшение мощности растений, улучшение качества растений, улучшенную выносливость к факторам стресса и/или улучшенный коэффициент использования ресурсов.

В соответствии с настоящим изобретением 'улучшение мощности растений' означает, что определенные признаки являются улучшенными качественно или количественно по сравнению с таким же признаком у контрольного растения, которое было выращено в таких же условиях без применения способа по настоящему изобретению. Такие признаки включают без ограничения раннее и/или улучшенное прорастание, улучшенную всхожесть, возможность применять меньшее количество семян, увеличенный рост корней, более развитую корневую систему, увеличенное образование корневых клубеньков, увеличенный рост побегов, увеличенное кущение, более сильные побеги, более продуктивные побеги, повышенную или улучшенную густоту стояния растений, меньшее "падение" растений (полегание), увеличение и/или улучшение высоты растений, увеличение массы растений (свежей или сухой), большие листовые пластинки, более зеленый цвет листа, повышенное содержание пигментов, повышенную фотосинтетическую активность, более раннее цветение, более длинные метелки, раннее созревание зерна, увеличенный размер семян, плодов или стручков, увеличенное количество стручков или колосьев, увеличенное количество семян на стручок или колос, увеличенную массу семян, увеличенный налив семян, меньшее количество опавших нижних листьев, задержку старения, улучшенную жизнеспособность растения, увеличенные уровни аминокислот в запасующих тканях и/или меньшее количество необходимых ресурсов (например, меньшее количество необходимых удобрений, воды и/или трудовых затрат). Растение с улучшенной мощностью может характеризоваться улучшением любого из вышеупомянутых признаков, или любой комбинации, или двух или более из вышеупомянутых признаков.

В соответствии с настоящим изобретением, 'улучшение качества растений' означает, что определенные признаки являются улучшенными качественно или количественно по сравнению с таким же признаком у контрольного растения, которое было выращено в таких же условиях без применения способа по настоящему изобретению. Такие признаки включают без ограничения улучшенный внешний вид растения, уменьшенное количество этилена (уменьшенное образование и/или подавление рецепции), улучшенное качество собранного материала, например, семян,

плодов, листьев, овощей (такое улучшенное качество может проявляться как улучшенный внешний вид собранного материала), улучшенное содержание углеводов (например, повышенные количества сахара и/или крахмала, улучшенный сахарокислотный коэффициент, уменьшение количества редуцирующих сахаров, 5 повышенный показатель выработки сахара), улучшенное содержание белка, улучшенное содержание и состав масла, улучшенную питательную ценность, уменьшение количества непитательных соединений, улучшенные органолептические свойства (например, улучшенные вкусовые свойства) и/или увеличенную пользу для здоровья потребителя (например, повышенные уровни витаминов и антиоксидантов)), 10 улучшенные послеуборочные характеристики (например, увеличенный срок хранения и/или стабильность при хранении, облегченную пригодность для химической переработки, облегченную экстракцию соединений), более однородное развитие сельскохозяйственной культуры (например, синхронизированные прорастание, цветение и/или плодоношение растений) и/или улучшенное качество семян (например, 15 для применения в следующих сезонах). Растение с улучшенным качеством может характеризоваться улучшением любого из вышеупомянутых признаков, или любой комбинации, или двух или более из вышеупомянутых признаков.

В соответствии с настоящим изобретением, 'улучшенная выносливость к стрессовым факторам' означает, что определенные признаки являются улучшенными 20 качественно или количественно по сравнению с таким же признаком у контрольного растения, которое было выращено при таких же условиях без применения способа по настоящему изобретению. Такие признаки включают без ограничения повышенную толерантность и/или устойчивость к абиотическим факторам стресса, которые обуславливают недостаточно оптимальные условия выращивания, такие как засуха 25 (например, любой стресс, который приводит к недостатку содержания воды в растениях, недостаточному потенциалу поглощения воды или снижению обеспечения растений водой), воздействие холода, воздействие тепла, осмотический стресс, УФ-стресс, затопление, повышенную засоленность (например, в почве), увеличенное воздействие минералов, воздействие озона, воздействие сильного освещения и/или 30 ограниченную доступность питательных веществ (например, азотсодержащих и/или фосфорсодержащих питательных веществ). Растение с улучшенной толерантностью к стрессовым факторам может характеризоваться улучшением любого из вышеупомянутых признаков, или любой комбинации, или двух или более из вышеупомянутых признаков. В случае стресса, вызванного засухой и недостатком

питательных веществ, такие улучшенные показатели толерантности могут быть обусловлены, например, более эффективным поглощением, применением или удержанием воды и питательных веществ.

В соответствии с настоящим изобретением, 'улучшенный коэффициент использования ресурсов' означает, что растения способны расти более эффективно с использованием данных уровней ресурсов по сравнению с ростом контрольных растений, которые выращиваются при таких же условиях без применения способа по настоящему изобретению. В частности, ресурсы включают без ограничения удобрение (такое как азотное, фосфорное, калийное, питательные микроэлементы), свет и воду.

Растение с улучшенным коэффициентом использования ресурсов может характеризоваться улучшенным использованием любого из вышеупомянутых ресурсов или любой комбинации двух или более из вышеупомянутых ресурсов.

Другие улучшения сельскохозяйственных культур по настоящему изобретению включают уменьшение высоты растения или снижение кущения, которые являются предпочтительными свойствами сельскохозяйственных культур, или условий, при которых желательно получать меньше биомассы и меньше побегов.

Любое или все из перечисленных выше улучшений сельскохозяйственных культур могут привести к улучшенной урожайности за счет улучшения, например, физиологии растений, роста и развития растений и/или строения растений. В контексте настоящего изобретения термин "урожайность" включает без ограничения (i) повышение скорости продуцирования биомассы, урожайности зерна, содержания крахмала, содержания масла и/или содержания белка, что может быть результатом (a) увеличения количества, продуцируемого растением *per se*, или (b) улучшенной способности к сбору растительного материала, (ii) улучшение состава собираемого материала (например, улучшенные сахарокислотные коэффициенты, улучшенный состав масла, повышенную питательную ценность, уменьшение количества непитательных соединений, повышенную пользу для здоровья потребителя) и/или (iii) повышенную/облегченную возможность сбора сельскохозяйственной культуры, улучшенную пригодность для переработки сельскохозяйственной культуры, лучшую стабильность при хранении/увеличенный срок хранения. Увеличенная урожайность сельскохозяйственного растения означает, что при наличии возможности выполнения количественного измерения урожайность продукта соответствующего растения увеличена на поддающееся измерению количество по сравнению с урожаем того же продукта растения, полученным при тех же условиях, но без применения настоящего

изобретения. Согласно настоящему изобретению предпочтительно, чтобы урожайность была увеличена на по меньшей мере 0,5%, предпочтительно на 1%, более предпочтительно на 2%, еще более предпочтительно на 4% или больше. Еще более предпочтительным является увеличение урожайности на по меньшей мере

5 приблизительно 5%, 10%, 15%, или 20%, или больше.

Любое или все из перечисленных выше улучшений сельскохозяйственных культур могут также привести к более рациональному использованию земли, то есть земля, которая ранее была недоступной или недостаточно оптимальной для

10 возделывания, может стать доступной. Например, растения, которые демонстрируют повышенную способность к выживанию в условиях засухи, можно культивировать в районах с недостаточно оптимальным количеством атмосферных осадков, например, которые граничат с пустыней или даже находятся в самой пустыне.

В одном варианте осуществления настоящее изобретение предусматривает способ улучшения переносимости сельскохозяйственными культурами факторов стресса путем

15 применения по отношению к растениям, частям растений, материалу для размножения растений или к месту произрастания растений соединения формулы (I). Фактор стресса может быть выбран из засухи, воздействия холода, воздействия тепла, осмотического стресса, затопления, заболачивания, повышенной солености (например, в почве), повышенного воздействия одного или нескольких минералов, воздействия озона,

20 воздействия ультрафиолетового излучения, воздействия яркого света, темноты (т. е. недостатка света в целом или короткой продолжительности дня), ограниченной доступности питательных веществ (например, азотных питательных веществ и фосфорных питательных веществ). В частности, фактор стресса выбран из воздействия низких температур, осмотического стресса (т. е. недостатка воды) и повышенной

25 солености; в особенности, стрессовым фактором является воздействие низких температур или повышенная соленость (особенно ее влияние на прорастание).

В одном аспекте настоящего изобретения улучшения сельскохозяйственной культуры осуществляются фактически в отсутствие воздействия вредителей и/или болезней. Например, вредителей и/или заболеваний можно контролировать с помощью

30 обработки пестицидами, которую применяют до осуществления способа по настоящему изобретению или одновременно с ним.

В сельскохозяйственной практике (инсектицидная) обработка семян зачастую (преимущественно) осуществляется фунгицидами; в этом отношении соединение формулы (I) может обеспечить синергизм в отношении защиты от болезней.

Облегчение абиотического стресса может также способствовать улучшению переносимости патогенов, тем самым способствуя фунгицидным свойствам.

Аналогичным образом улучшенная всхожесть благодаря соединению формулы (I) может привести к повышению устойчивости проростков к повреждению насекомыми, что само по себе может привести к снижению чувствительности к болезням. Таким образом, улучшение сельскохозяйственной культуры благодаря соединению формулы (I) может также привести к так называемому эффекту домино в отношении облегчения биотического стресса.

Сельскохозяйственные культуры полезных растений, в отношении которых можно применять способ в соответствии с настоящим изобретением, предусматривают многолетние и однолетние сельскохозяйственные культуры, такие как ягодные растения, например, сорта ежевики, черники, клюквы, малины и клубники; зерновые, например, ячмень, маис (кукуруза), просо, овес, рис, рожь, сорго, тритикале и пшеница; волокнистые растения, например, хлопчатник, лен, конопля, джут и сизаль; полевые сельскохозяйственные культуры, например, сахарная и кормовая свекла, кофе, сорта хмеля, горчица, масличный рапс (канола), мак, сахарный тростник, подсолнечник, чайный куст и табак; плодовые деревья, например, яблоня, абрикос, авокадо, банановое дерево, вишня, цитрусовые, нектарин, персик, груша и слива; травянистые растения, например, бермудская трава, мятлик, полевица, зримохля змеихвостая, овсяница, плевел, августинова трава и цойсия японская; травы, такие как базилик, бурачник, шнитт-лук, кориандр, лаванда, любисток, мята, орегано, петрушка, розмарин, шалфей и тимьян; зернобобовые культуры; бобовые, например, сорта фасоли, чечевица, сорта гороха и сорта сои; орехи, например, миндаль, кешью, земляной орех, лещина, арахис, пекан, фисташки и грецкий орех; пальмы, например, масличная пальма; декоративные растения, например, цветы, кустарники и деревья; другие деревья, например, какао-дерево, кокосовая пальма, оливковое дерево и каучуковое дерево; овощные культуры, например, спаржа, баклажан, брокколи, капуста, морковь, огурец, чеснок, салат-латук, кабачок, дыня, окра, лук репчатый, перец, картофель, тыква, ревень, шпинат и томат, и древовидные лианы, например, виноград.

Предпочтительно сельскохозяйственная культура представляет собой зерновую культуру, бобовую культуру, канолу или кукурузу; в частности пшеницу или кукурузу, предпочтительно пшеницу.

Следует понимать, что сельскохозяйственные культуры также предусматривают такие сельскохозяйственные культуры, которые встречаются в природе, получены

общепринятыми способами селекции или получены посредством генной инженерии. Они предусматривают сельскохозяйственные культуры, которые характеризуются так называемыми привнесенными признаками (например, улучшенной стойкостью при хранении, более высокой питательной ценностью и улучшенными

5 вкусоароматическими качествами).

Под сельскохозяйственными культурами также следует понимать те сельскохозяйственные культуры, которым придали выносливость к гербицидам, таким как бромоксинил, или к классам гербицидов, таким как ингибиторы ALS, EPSPS, GS, HPPD и PPO. Примером сельскохозяйственной культуры, которой придали

10 выносливость в отношении имидазолинонов, например имазамокса, посредством общепринятых способов селекции, является яровая канولا Clearfield®. Примеры сельскохозяйственных культур, которым с помощью способов генной инженерии придали выносливость в отношении гербицидов, включают, например, устойчивые к глифосату и глюфосинату сорта маиса, коммерчески доступные под торговыми
15 названиями RoundupReady®, Herculex I® и LibertyLink®.

Под сельскохозяйственными культурами также следует понимать культуры, которые по своей природе являются устойчивыми, или культуры, которым придали устойчивость к вредным насекомым. Они предусматривают растения, трансформированные с применением технологий рекомбинантной ДНК, например,
20 таким образом, что они способны синтезировать один или несколько токсинов селективного действия, таких, которые известны, например, у токсин-продуцирующих бактерий. Примеры токсинов, которые могут быть экспрессированы, включают δ-эндотоксины, вегетативные инсектицидные белки (Vip), инсектицидные белки бактерий, колонизирующих нематод, и токсины, продуцируемые скорпионами,
25 паукообразными, осами и грибами.

Примером сельскохозяйственной культуры, которая была модифицирована для экспрессии токсина *Bacillus thuringiensis*, является Bt-маис KnockOut® (Syngenta Seeds). Примером сельскохозяйственной культуры, содержащей несколько генов, которые кодируют устойчивость к насекомым, и, таким образом, экспрессирующей
30 несколько токсинов, является VipCot® (Syngenta Seeds). Сельскохозяйственные культуры или их семенной материал также могут быть устойчивыми к нескольким типам вредителей (так называемые трансгенные объекты с пакетированными генами, если получены посредством генетической модификации). Например, растение может характеризоваться способностью к экспрессии инсектицидного белка, являясь

одновременно выносимым в отношении гербицидов, например, Herculex I® (Dow AgroSciences, Pioneer Hi-Bred International).

Соединение формулы (I) может применяться в немодифицированной форме, но обычно его составляют в композицию различными способами с применением вспомогательных веществ для составления, таких как носители, растворители и поверхностно-активные вещества. Составы могут быть представлены в различных физических формах, например, в форме распыляемых порошков, гелей, смачиваемых порошков, диспергируемых в воде гранул, диспергируемых в воде таблеток, шипучих пеллет, эмульгируемых концентратов, концентратов микроэмульсий, эмульсий типа "масло в воде", масляных текучих составов, водных дисперсий, масляных дисперсий, суспензий, капсульных суспензий, эмульгируемых гранул, растворимых жидкостей, водорастворимых концентратов (с водой или смешиваемым с водой органическим растворителем в качестве носителя), пропитанных полимерных пленок или в других формах, известных, например, из Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides, United Nations, First Edition, Second Revision (2010). Такие составы можно либо применять непосредственно, либо разбавлять перед применением. Разбавления можно осуществлять, например, с помощью воды, жидких удобрений, питательных микроэлементов, биологических организмов, масла или растворителей.

Составы можно получить, например, смешиванием соединения формулы (I) («активный ингредиент») со вспомогательными веществами для составления с целью получения композиций в форме мелкоизмельченных твердых веществ, гранул, растворов, дисперсий или эмульсий. Активный ингредиент также можно составлять с другими вспомогательными веществами, такими как тонкодисперсные твердые вещества, минеральные масла, масла растительного или животного происхождения, модифицированные масла растительного или животного происхождения, органические растворители, вода, поверхностно-активные вещества или их комбинации.

Активный ингредиент также может содержаться в очень мелких микрокапсулах. В микрокапсулах активный ингредиент содержится в пористом носителе. Это обеспечивает возможность высвобождения активного ингредиента в окружающую среду в регулируемых количествах (например, медленное высвобождение).

Микрокапсулы обычно имеют диаметр от 0,1 до 500 микрон. Они содержат активный ингредиент в количестве от приблизительно 25 до 95% по весу от веса капсулы.

Активный ингредиент может находиться в форме монолитного твердого вещества, в

форме мелких частиц в твердой или жидкой дисперсии или в форме подходящего раствора. Инкапсулирующие мембраны могут содержать, например, природные и синтетические каучуки, целлюлозу, сополимеры стирола и бутадиена, полиакрилонитрил, полиакрилат, сложные полиэфиры, полиамиды, полимочевины, полиуретан или химически модифицированные полимеры и ксантаты крахмала или другие полимеры, которые известны специалисту в данной области техники. Альтернативно могут быть образованы очень мелкие микрокапсулы, в которых активный ингредиент содержится в форме тонкодисперсных частиц в твердой матрице основного вещества, однако микрокапсулы сами по себе не являются инкапсулированными.

Вспомогательные вещества для составления, которые являются подходящими для получения композиций в соответствии с настоящим изобретением, являются известными *per se*. В качестве жидких носителей можно использовать следующее: воду, толуол, ксилол, петролейный эфир, растительные масла, ацетон, метилэтилкетон, циклогексанон, ангидриды кислот, ацетонитрил, ацетофенон, амилацетат, 2-бутанон, бутиленкарбонат, хлорбензол, циклогексан, циклогексанол, сложные алкиловые эфиры уксусной кислоты, диацетоновый спирт, 1,2-дихлорпропан, диэтаноламин, п-диэтилбензол, диэтиленгликоль, диэтиленгликоля абиеат, простой бутиловый эфир диэтиленгликоля, простой этиловый эфир диэтиленгликоля, простой метиловый эфир диэтиленгликоля, *N,N*-диметилформамид, диметилсульфоксид, 1,4-диоксан, дипропиленгликоль, простой метиловый эфир дипропиленгликоля, дибензоат дипропиленгликоля, дипрокситол, алкилпирролидон, этилацетат, 2-этилгексанол, этиленкарбонат, 1,1,1-трихлорэтан, 2-гептанон, альфа-пинен, d-лимонен, этиллактат, этиленгликоль, простой бутиловый эфир этиленгликоля, простой метиловый эфир этиленгликоля, гамма-бутиролактон, глицерин, ацетат глицерина, диацетат глицерина, триацетат глицерина, гексадекан, гексиленгликоль, изоамилацетат, изоборнилацетат, изооктан, изофорон, изопропилбензол, изопропилмиристат, молочную кислоту, лауриламин, мезитилоксид, метоксипропанол, метилизоамилкетон, метилизобутилкетон, метиллаурат, метилоктаноат, метилолеат, метиленхлорид, м-ксилол, *n*-гексан, *n*-октиламин, октадекановую кислоту, октиламинацетат, олеиновую кислоту, олеиламин, о-ксилол, фенол, полиэтиленгликоль, пропионовую кислоту, пропиллактат, пропиленкарбонат, пропиленгликоль, простой метиловый эфир пропиленгликоля, п-ксилол, толуол, триэтилфосфат, триэтиленгликоль, ксилолсульфоновую кислоту, парафин, минеральное масло, трихлорэтилен,

перхлорэтилен, этилацетат, амилацетат, бутилацетат, простой метиловый эфир пропиленгликоля, простой метиловый эфир диэтиленгликоля, метанол, этанол, изопропанол и высокомолекулярные спирты, такие как амиловый спирт, тетрагидрофурфуриловый спирт, гексанол, октанол, этиленгликоль, пропиленгликоль, глицерин, *N*-метил-2-пирролидон и т. п.

Подходящими твердыми носителями являются, например, тальк, диоксид титана, пирофиллитовая глина, диоксид кремния, аттапульгитовая глина, кизельгур, известняк, карбонат кальция, бентонит, кальциевый монтмориллонит, шелуха семян хлопчатника, пшеничная мука, соевая мука, пемза, древесная мука, измельченная скорлупа грецких орехов, лигнин и подобные вещества.

Большое количество поверхностно-активных веществ можно успешно использовать как в твердых, так и в жидких составах, особенно в тех составах, которые можно разбавлять носителем перед применением. Поверхностно-активные вещества могут быть анионными, катионными, неионогенными или полимерными, и их можно применять в качестве эмульгаторов, смачивающих средств или суспендирующих средств или для других целей. Типичные поверхностно-активные вещества предусматривают, например, соли алкилсульфатов, такие как лаурилсульфат диэтаноламмония, соли алкиларилсульфонатов, такие как додецилбензолсульфонат кальция, продукты присоединения алкилфенола/алкиленоксида, такие как этоксилат нонилфенола, продукты присоединения спирта/алкиленоксида, такие как этоксилат тридецилового спирта, мыла, такие как стеарат натрия, соли алкилнафталинсульфонатов, такие как дибутилнафталинсульфонат натрия, диалкиловые сложные эфиры сульфосукцинатных солей, такие как ди(2-этилгексил)сульфосукцинат натрия, сложные эфиры сорбита, такие как сорбитолеат, четвертичные амины, такие как хлорид лаурилтриметиламмония, полиэтиленгликолевые сложные эфиры жирных кислот, такие как стеарат полиэтиленгликоля, блок-сополимеры этиленоксида и пропиленоксида и соли моно- и диалкилфосфатных сложных эфиров, а также дополнительные вещества, описанные, например, в McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey (1981).

Дополнительные вспомогательные вещества, которые можно использовать в пестицидных составах, включают ингибиторы кристаллизации, модификаторы вязкости, суспендирующие средства, красители, антиоксиданты, вспенивающие средства, поглотители света, вспомогательные средства для смешивания,

противовспениватели, комплексообразующие средства, нейтрализующие или pH-модифицирующие вещества и буферы, ингибиторы коррозии, отдушки, смачивающие средства, усилители поглощения, питательные микроэлементы, пластификаторы, вещества, способствующие скольжению, смазывающие вещества, диспергирующие вещества, загустители, антифризы, микробициды, а также жидкие и твердые удобрения.

Композиции согласно настоящему изобретению могут включать добавку, содержащую масло растительного или животного происхождения, минеральное масло, сложные алкиловые эфиры таких масел или смеси таких масел и производные масел.

Количество масляной добавки в композиции согласно настоящему изобретению обычно составляет от 0,01 до 10% в пересчете на активный ингредиент, подлежащий применению. Например, масляную добавку можно добавлять в резервуар опрыскивателя в необходимой концентрации после приготовления смеси для опрыскивания. Предпочтительные масляные добавки содержат минеральные масла или масло растительного происхождения, например, рапсовое масло, оливковое масло или подсолнечное масло, эмульгированное растительное масло, сложные алкиловые эфиры масел растительного происхождения, например метиловые производные, или масло животного происхождения, такое как рыбий жир или говяжий жир. Предпочтительные масляные добавки содержат сложные алкиловые эфиры C₈-C₂₂-жирных кислот, особенно метиловые производные C₁₂-C₁₈-жирных кислот, например, сложные метиловые эфиры лауриновой кислоты, пальмитиновой кислоты и олеиновой кислоты (метиллаурат, метилпальмитат и метилолеат соответственно). Многие производные масел известны из Compendium of Herbicide Adjuvants, 10th Edition, Southern Illinois University, 2010.

Композиции, как правило, содержат от 0,1 до 99% по весу, в частности от 0,1 до 95% по весу, соединения по настоящему изобретению и от 1 до 99,9% по весу вспомогательного вещества для составления, которое предпочтительно включает от 0 до 25% по весу поверхностно-активного вещества. Поскольку коммерческие продукты предпочтительно могут быть составлены в виде концентратов, то конечный потребитель обычно будет использовать разбавленные составы.

Нормы применения варьируются в широких пределах и зависят от свойств почвы, способа применения, культурного растения, вредителя, подлежащего контролю, преобладающих климатических условий и других факторов, определяемых способом применения, временем применения и целевой сельскохозяйственной культурой. В

качестве общего руководства соединение формулы I можно применять при норме от 1 до 2000 л/га, в частности от 10 до 1000 л/га.

Предпочтительные составы могут характеризоваться следующими композициями (вес. %).

5 Эмульгируемые концентраты:

активный ингредиент: от 1 до 95%, предпочтительно от 60 до 90%
поверхностно-активное средство: от 1 до 30%, предпочтительно от 5 до 20%
жидкий носитель: от 1 до 80%, предпочтительно от 1 до 35%

Пылевидные препараты:

10 активный ингредиент: от 0,1 до 10%, предпочтительно от 0,1 до 5%
твердый носитель: от 99,9 до 90%, предпочтительно от 99,9 до 99%

Суспензионные концентраты:

активный ингредиент: от 5 до 75%, предпочтительно от 10 до 50%
вода: от 94 до 24%, предпочтительно от 88 до 30%
15 поверхностно-активное средство: от 1 до 40%, предпочтительно от 2 до 30%.

Смачиваемые порошки:

активный ингредиент: от 0,5 до 90%, предпочтительно от 1 до 80%
поверхностно-активное средство: от 0,5 до 20%, предпочтительно от 1 до 15%
твердый носитель: от 5 до 95%, предпочтительно от 15 до 90%

20 Гранулы:

активный ингредиент: от 0,1 до 30%, предпочтительно от 0,1 до 15%
твердый носитель: от 99,5 до 70%, предпочтительно от 97 до 85%

Следующие примеры дополнительно иллюстрируют, но не ограничивают настоящее изобретение.

25

<u>Смачиваемые порошки</u>	a)	b)	c)
активный ингредиент	25%	50%	75%
лигносульфонат натрия	5%	5%	-
лаурилсульфат натрия	3%	-	5%
дизобутилнафталинсульфонат натрия	-	6%	10%
феноловый эфир полиэтиленгликоля	-	2%	-
(7-8 моль этиленоксида)			
высокодисперсная кремниевая кислота	5%	10%	10%

каолин	62%	27%	-
--------	-----	-----	---

Комбинацию тщательно перемешивают со вспомогательными средствами и смесь тщательно измельчают в подходящей мельнице с получением смачиваемых порошков, которые можно разбавлять водой с получением суспензий требуемой концентрации.

<u>Порошки для сухой обработки семян</u>	a)	b)	c)
активный ингредиент	25%	50%	75%
легкое минеральное масло	5%	5%	5%
высокодисперсная кремниевая кислота	5%	5%	-
каолин	65%	40%	-
тальк	-		20

5

Комбинацию тщательно смешивают со вспомогательными средствами и смесь тщательно измельчают в подходящей мельнице с получением порошков, которые можно непосредственно использовать для обработки семян.

<u>Эмульгируемый концентрат</u>	
активный ингредиент	10%
простой октилфеноловый эфир полиэтиленгликоля	3%
(4-5 моль этиленоксида)	
додecilбензолсульфонат кальция	3%
простой полигликолевый эфир касторового масла (35 моль этиленоксида)	4%
циклогексанон	30%
смесь ксилолов	50%

- 10 Из этого концентрата путем разбавления водой можно получить эмульсии любого необходимого разбавления, которые можно применять для защиты растений.

<u>Пылевидные препараты</u>	a)	b)	c)
активный ингредиент	5%	6%	4%
Тальк	95%	-	-
Каолин	-	94%	-
минеральный наполнитель	-	-	96%

Готовые к применению пылевидные препараты получают путем перемешивания комбинации с носителем и измельчения смеси в подходящей мельнице. Такие порошки также можно применять для сухого протравливания семян.

<u>Экструдированные гранулы</u>	
активный ингредиент	15%
лигносульфонат натрия	2%
карбоксиметилцеллюлоза	1%
каолин	82%

- 5 Комбинацию перемешивают и измельчают со вспомогательными средствами и смесь увлажняют водой. Смесь экструдировать и затем высушивают в потоке воздуха.

<u>Покрываемые оболочкой гранулы</u>	
активный ингредиент	8%
полиэтиленгликоль (молекулярная масса 200)	3%
каолин	89%

- 10 Тонкоизмельченную комбинацию в перемешивающем устройстве равномерно наносят на увлажненный полиэтиленгликолем каолин. Таким способом получают непылевидные покрываемые оболочкой гранулы.

Суспензионный концентрат

активный ингредиент	40%
пропиленгликоль	10%
нонилфенолполиэтиленгликолевый эфир (15 моль этиленоксида)	6%
лигносульфонат натрия	10%
карбоксиметилцеллюлоза	1%
Силиконовое масло (в форме 75% эмульсии в воде)	1%
Вода	32%

- 15 Тонкоизмельченную комбинацию тщательно смешивают со вспомогательными веществами с получением суспензионного концентрата, из которого путем разбавления водой можно получать суспензии любого необходимого разбавления. С применением таких разбавленных растворов можно обрабатывать и защищать от заражения

микроорганизмами живые растения, а также материал для размножения растений путем опрыскивания, полива или погружения.

Текущий концентрат для обработки семян

активный ингредиент	40%
пропиленгликоль	5%
сополимер бутанола и РО/ЕО	2%
Тристиролфенол с 10-20 молями ЕО	2%
1,2-бензизотиазолин-3-он (в виде 20% раствора в воде)	0,5%
кальциевая соль моноазопигмента	5%
Силиконовое масло (в форме 75% эмульсии в воде)	0,2%
Вода	45,3%

5 Тонкоизмельченную комбинацию тщательно смешивают со вспомогательными веществами с получением суспензионного концентрата, из которого путем разбавления водой можно получать суспензии любого необходимого разбавления. С применением таких разбавленных растворов можно обрабатывать и защищать от заражения микроорганизмами живые растения, а также материал для размножения растений путем опрыскивания, полива или погружения.

Капсульная суспензия с медленным высвобождением

Смешивают 28 частей соединения по настоящему изобретению с 2 частями ароматического растворителя и 7 частями смеси толуолдиизоцианат/полиметилениполифенилизоцианат (8:1). Эту смесь эмульгируют в смеси из 1,2 части поливинилового спирта, 0,05 части пеногасителя и 51,6 части воды до получения частиц требуемого размера. К этой эмульсии добавляют смесь из 2,8 части 1,6-диаминогексана в 5,3 части воды. Смесь перемешивают до завершения реакции полимеризации. Полученную капсульную суспензию стабилизируют путем добавления 0,25 части загустителя и 3 частей диспергирующего средства. В составе капсульной суспензии содержится 28% активного ингредиента. Средний диаметр капсул составляет 8-15 микрон. Полученный состав применяют по отношению к семенам в виде водной суспензии в устройстве, подходящем для данной цели.

Количество, в котором будут применять активный ингредиент, будет зависеть от различных факторов, таких как объект обработки, как например, растения, почва или семена; тип обработки, как например, опрыскивание, опыление или протравливание

семян; цель обработки, как например, профилактическая или терапевтическая; или время применения.

При нанесении на полезные растения активный ингредиент обычно наносят в количестве от 5 до 2000 г а.и./га, в частности, от 10 до 1000 г а.и./га, т. е. 50, 75, 100 или 200 г а.и./га.

В сельскохозяйственной практике нормы применения активного ингредиента зависят от типа желаемого эффекта и, как правило, находятся в диапазоне от 20 до 4000 г всей композиции на гектар.

Время нанесения композиции на полезные растения или их место произрастания будет зависеть от типа сельскохозяйственной культуры и требуемого улучшения сельскохозяйственной культуры. Например, соединение формулы (I) можно применять перед ожидаемой засухой для обеспечения защиты от ее воздействия или на определенной стадии роста растения для обеспечения защитного действия и/или сохранения/улучшения урожайности в условиях стресса. В случае пшеницы, например, соединение формулы (I) можно применять во время роста в длину или выхода в трубку и до середины колошения (во время или между BBCH 30-55). В случае сои, например, соединение формулы (I) можно применять на стадиях роста R1 и R3 или между ними.

Если композицию используют для обработки семян, нормы внесения от 0,001 до 50 г соединения формулы I на кг семян, предпочтительно от 0,01 до 10 г на кг семян, обычно являются достаточными.

Соответственно, соединение формулы (I) применяют при посеве в качестве обработки семени или почвы.

Обычно, фермер при возделывании сельскохозяйственной культуры будет применять одно или несколько других агрономических химических средств помимо соединения по настоящему изобретению. Примеры агрономических химических средств включают пестициды, такие как акарициды, бактерициды, фунгициды, гербициды, инсектициды, нематоциды, а также питательные вещества для растений и удобрения для растений. Соответственно, настоящее изобретение также предусматривает применение соединения формулы (I) вместе с одним или несколькими пестицидами, питательными веществами для растений или удобрениями для растений. Комбинация может также охватывать конкретные признаки растения, которые включены в растение с использованием любых средств, например, традиционной селекции или генетической модификации.

(CuSO₄), сульфат цинка (ZnSO₄), хлорид никеля (NiCl₂), сульфат кобальта (CoSO₄), гидроксид калия (KOH), хлорид натрия (NaCl), борную кислоту (H₃BO₃) и их соли металлов (Na₂MoO₄). Питательные вещества могут присутствовать в количестве, составляющем от 5% до 50% по весу, предпочтительно от 10% до 25% по весу или от 15% до 20% по весу каждого. Предпочтительными дополнительными питательными веществами являются мочевины ((NH₂)₂CO), меламин (C₃H₆N₆), оксид калия (K₂O) и неорганические нитраты. Наиболее предпочтительным дополнительным растительным питательным веществом является оксид калия. Если предпочтительным дополнительным питательным веществом является мочевины, то она, в целом, присутствует в количестве от 1% до 20% по весу, предпочтительно от 2% до 10% по весу или от 3% до 7% по весу.

Соединение формулы (I) может также применяться в комбинации с одним или несколькими из следующих соединений для улучшения сельскохозяйственных культур.

хлорпрофам, цикланилид, даминозид, дикегулак, диметипин, этефон, флуметралин, флурпримидол, флуоридамид, форхлорфенурон, фосамин, гиббереллиновая кислота, глифосин, изопиримол, жасмоновая кислота, малеиновый гидразид, мефлуидид, мепикват, метилциклопропен, паклобутразол, пипроктанил, прогексадион, прогексадион-кальций, прогидрожасмон, профам, тетсикласис, тидиазурон, трибутилфосфотритиоат, тяоцзеань, тринексапак, тринексапак-этил, 2,3,5-трийодбензойная кислота, юниконзол.

Активаторы растений, в том числе: ацибензолар, ацибензолар-S-метил, хитозан, пробеназол, экстракт *Reynoutria sachalinensis*, тиадинил.

30 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DEP, дихлорпроп, фенопроп, индол-3-уксусная кислота (IAA), индол-3-масляная кислота (IBA), 1-нафталинуksусная кислота (NAA), 1-нафтол, триптофан), брассиностероиды, цитокины (1,3-дифенилмочевина, 2iP, 4-гидроксифенетиловый спирт, аденин, бензиладенин, кинетин, тидиазурон, зеатин), этилен, этиленовые ингибиторы (1-метилциклопропен, авиглицин), этиленовые

средства высвобождения (АСС, этаселасил, этефон, глиоксим), гиббереллин (GA1, GA2, гиббереллиновая кислота GA3, GA4, GA5, GA6, GA7, GA8, GA9, GA10, GA11, GA12, GA13, GA14, GA15, GA16, GA17, GA18, GA19, GA20, GA21, GA22, GA23, GA24, GA25, GA26, GA27, GA28, GA29, GA30, GA31, GA32, GA33, GA34, GA35, GA36, GA37, GA38, GA39, GA40, GA41, GA42, GA43, GA44, GA45, GA46, GA47, GA48, GA49, GA50, GA51, GA52, GA53, GA54, GA55, GA56, GA57, GA58, GA59, GA60, GA61, GA62, GA63, GA64, GA65, GA66, GA67, GA68, GA69, GA70, GA71, GA72, GA73, GA74, GA75, GA76, GA77, GA78, GA79, GA80, GA81, GA82, GA83, GA84, GA85, GA86, GA87, GA88, GA89, GA90, GA91, GA92, GA93, GA94, GA95, GA96, GA97, GA98, GA99, GA100, GA101, GA102, GA103, GA104, GA105, GA106, GA107, GA108, GA109, GA110, GA111, GA112, GA113, GA114, GA115, GA116, GA117, GA118, GA119, GA120, GA121, GA122, GA123, GA124, GA125, GA126, GA127, GA128, GA129, GA130, GA131, GA132, GA133, GA134, GA135, GA136), жасмонаты (жасмоновая кислота, метилжасмонат), салицилаты (салициловая кислота), стриголактоны (GR24, стригол, стригилацетат, оробанхол, оробанхилацетат, дезоксистригол, сорголактон).

Дефолианты, в том числе: цианамид кальция, диметипин, эндотал, этефон, мерфос, метоксурон, пентахлорфенол, тидиазурон, трибуфос.

Вспомогательные для питательных вещества, в том числе: удобрения (азот, фосфор, калий), макроэлементы (кальций, магний, сера), микроэлементы (бор, медь, железо, хлорид, марганец, молибден, цинк), заменимые пищевые вещества (кобальт, кремний, никель), аминокислоты (Isabion®, Quantis®, Hyt®), хелат железа (Sequestrene®), азотфиксирующие бактерии (Rhizobium), фосфорсолубилизирующие бактерии (*Penicillium bilaii* (JumpStart®)).

Пестициды с вторичными эффектами улучшения сельскохозяйственных культур: азоксистробин, дифеноконазол, изопиразам, пираклостробин, седаксан, тиаметоксам, тринексапак-этил.

Другие соединения для улучшения сельскохозяйственных культур, в том числе: стимуляторы роста (24-эпибрассинолид, 28-гомобрассинолид, брассинолид, брассинолид-этил, DCPTA, форхлорфенурон, химексазол, просулер, пирипропанол, триаконтанол), каррикины (KAR1, KAR2, KAR3, KAR4), липохитоолигосахариды, полиамины, неклассифицированные регуляторы роста растений (2,4,5-Т, 2-гидразиноэтанол, бахмедеш, бензофлуор, буминафос, карвон, хлорфлурен, хлорфлуренол, холинхлорид, циобутид, клофенцет, клофибровая кислота, клопроп,

клоксифонак, цианамид, цикланилид, циклогексимид, ципросульфамид, дихлорфлуренол, димексано, эпоколеон, этилхлозат, фенридазон, флуренол, фуфентиомочевина, фуранлан, гептопаргил, гексафторацетон тригидрат, голосулф, инабенфид, изопротиолан, каретазан, арсенат свинца, МСРВ, метасульфокарб, пиданон, синтофен, текназен, триапентенол).

Термин "фунгицид", используемый в данном документе, означает соединение, которое обеспечивает контроль, модифицирование или предотвращение роста грибов. Термин "фунгицидно эффективное количество" означает количество такого соединения или комбинации таких соединений, которое способно оказывать эффект в отношении роста грибов. Контролирующие или модифицирующие эффекты включают все отклонения от естественного развития, такие как уничтожение, торможение развития и т. п., и предотвращение включает барьер или другое защитное образование в растении или на нем для предотвращения грибковой инфекции.

Термин "гербицид", используемый в данном документе, означает соединение, с помощью которого контролируют или модифицируют рост растений. Термин "гербицидно эффективное количество" означает количество такого соединения или комбинации таких соединений, которое способно обеспечивать контролирующий или модифицирующий эффект в отношении роста растений. Эффекты в отношении контроля или модификации включают все отклонения от естественного развития, например, уничтожение, торможение развития, ожог листьев, альбинизм, карликовость и т. д.

Термин "инсектицид", используемый в данном документе, означает соединение, с помощью которого контролируют или модифицируют рост насекомых. Термин "инсектицидно эффективное количество" означает количество таких соединения или комбинации таких соединений, с помощью которого можно уничтожать, контролировать или заражать насекомых, замедляя рост или размножение насекомых, снижая численность популяции насекомых и/или уменьшая повреждения растений, обусловленные насекомыми.

Термин "нематоцид", используемый в данном документе, означает соединение, с помощью которого контролируют или модифицируют рост нематод. Термин "нематоцидно эффективное количество" означает количество таких соединения или комбинации таких соединений, с помощью которого можно уничтожать, контролировать или заражать нематод, замедляя рост или размножение нематод,

снижая численность популяции нематод и/или уменьшая повреждения растений, обусловленные нематодами.

Термин "место произрастания", используемый в данном документе, означает поля, в которых или на которых выращивают растения, или где высевает семена культивируемых растений, или где семена будут помещать в почву. Он предусматривает почву, семена и проростки, а также уже выращенную растительность.

Термин "растения" относится ко всем физическим частям растения, в том числе семенам, проросткам, саженцам, корням, клубням, стеблям, черешкам, листьям и плодам.

Термин "материал для размножения растений" означает все генеративные части растения, например, семена или вегетативные части растений, такие как черенки и клубни. Он включает семена в узком смысле, а также корни, плоды, клубни, луковицы, корневища и части растений.

Пестицидные средства, указанные в данном документе с использованием их общепринятых названий, известны, например, из "The Pesticide Manual", 15th Ed., British Crop Protection Council 2009.

Различные аспекты и варианты осуществления настоящего изобретения теперь будут более детально проиллюстрированы посредством примера и нижеследующих примеров:

ПРИМЕР 1

Этот пример иллюстрирует, что изоциклосерам проявляет постоянное влияние на кинетику прорастания семян кукурузы при низкой температуре (15°C).

Семена кукурузы (разновидность NK Falkone, Syngenta Seeds SAS, St. Sauveur, Франция) сортировали по размеру с помощью сита для исключения круглых семян.

Семена кукурузы помещали в 24-луночные планшеты (по 1 семени на лунку; каждый планшет считали одной экспериментальной единицей или повторностью). Прорастание инициировали добавлением в каждую лунку 250 мкл дистиллированной воды, содержащей 0,5% диметилсульфоксида (DMSO) (с изоциклосерамом, присутствующим в концентрации 1, 5, 25 или 125 мкМ). Для каждой характеристики в рамках обработки использовали 8 повторностей (т. е. 8 планшетов). Планшеты герметично закрывали с использованием герметизирующей пленки (полиолефин, № кат. 900320) от HJ-BIOANALYTIK. Все планшеты помещали в климатическую камеру при температуре либо 15°C, либо 23°C и относительной влажности 60%. Эксперимент был построен по полностью рандомизированной схеме.

Прорастание, происходившее с течением времени, регистрировали путем фотографирования в различных временных точках. Анализ изображений проводили автоматически с использованием макроса, разработанного с использованием программного обеспечения Image J. Кинетический анализ прорастания проводили

5 путем построения кривой тренда. Из кривой тренда рассчитывали три параметра: T50 (время, необходимое для 50% прорастания, связанное со скоростью прорастания); наклон кривой (равномерность прорастания) и плато (общий процент проросших семян).

Обработка изоциклосоерамом (1, 5, 25 и 125 мкМ) привела к значительным

10 изменениям в скорости и однородности прорастания, особенно в более холодных условиях и при более высоких концентрациях, что указывает на неожиданный эффект изоциклосоерама. Результаты выражены в процентах по сравнению с контролем (необработанные семена) для каждой температурной группы соответственно. Результаты были проанализированы статистически, чтобы выделить значимые

15 различия ($p < 0,05$). (Ключ: Знач. = значимое; нз = незначимое)

Таблица 1. Испытание на прорастание кукурузы при 23°C (нормальные условия)

Обработка	Время, необходимое для достижения 50% прорастания кукурузы			Однородность прорастания (наклон кривой)			Плато прорастания (общая доля в процентах проросших семян)		
Концентрация изоциклосоерама	Относительный T50	LS D	Знач.	Относительный наклон	LS D	Знач.	Общий % проросших семян	LS D	Знач.
Без обработки	100			100			100		
1 мкМ	107,32	3,6	Медленнее	80,22	16,25	Менее однородное	103,63	4,36	нз
5 мкМ	105,17	3,6	Медленнее	93,8	16,25	нз	103,63	4,36	нз
25 мкМ	95,22	3,6	Быстрее	133,81	16,25	Более однородное	105,39	4,36	Более высокий уровень
125 мкМ	92,47	3,6	Быстрее	176,64	16,25	Более однородное	100,7	4,36	нз

Таблица 2. Испытание на прорастание кукурузы при 15°C (холодные условия)

Обработка	Время, необходимое для достижения 50% прорастания кукурузы			Однородность прорастания (наклон кривой)			Плато прорастания (общая доля в процентах проросших семян)		
	Относительный T50	LSD	Знач.	Относительный наклон	LSD	Знач.	Общий % проросших семян	LSD	Знач.
Концентрация изоцикло-серама									
Без обработки	100			100			100		
1 мкМ	99,67	2,84	нз	100	17,0	нз	103	4,5	нз
5 мкМ	101,73	2,84	нз	98	17,0	нз	105	4,5	Более высокий уровень
25 мкМ	93,1	2,84	Быстрее	233	17,0	Более однородное	106	4,5	Более высокий уровень
125 мкМ	90,61	2,84	Быстрее	191	17,0	Более однородное	105	4,5	Более высокий уровень

Все три параметра имеют большое агрономическое значение. Значимые различия между обработанными семенами и необработанным контролем приведены при $p < 0,05$ (Anova). Параметр T50 соответствует промежутку времени, необходимому для прорастания половины семян из популяции; более низкие значения указывают на более быстрое прорастание. Наклон показывает, насколько синхронным является прорастание семян из популяции; значения больше 100 указывают на более крутую кривую. Чем больше наклон кривой, тем лучше и равномернее прорастание.

Как в нормальных, так и в холодных условиях однородность прорастания, выраженная в виде наклона кривой при двух самых высоких значениях доз, 25 и 125 мкМ, была значительно лучше, чем в случае необработанного контроля. В холодных условиях общее количество проросших семян (плато) было значительно улучшено в случае трех самых высоких концентраций. При двух самых высоких показателях скорость прорастания (T50) была выше при обеих температурах, что указывает на положительное влияние на скорость прорастания.

ПРИМЕР 2

Этот пример иллюстрирует, что изоциклосерам демонстрирует постоянное влияние на кинетику прорастания семян пшеницы в условиях повышенной засоленности (т. е. в условиях солевого стресса).

Семена пшеницы (сорт озимой пшеницы Syllon, Syngenta Seeds) помещали в 24-луночные планшеты (по 1 семени на лунку, каждый планшет считали одной экспериментальной единицей или повторностью). Прорастание в условиях солевого

стресса измеряли при различных концентрациях в планшетах с лунками, и было обнаружено, что оно значительно замедляется на 5-10% при более высоких значениях прорастания T50 при использовании 200 мкл 12,5 мМ раствора NaCl, содержащего 0,5% DMSO, на лунку. Затем готовили солевой раствор с этой концентрацией и добавляли испытуемое соединение с разными скоростями, как показано ниже в таблице 3, и повторяли испытание на прорастание в условиях солевого стресса. Для каждой обработки использовали восемь повторностей (т. е. 8 планшетов). Планшеты герметично закрывали герметизирующей пленкой (полиолефин, № кат. 900320) от HJ-BIOANALYTIK. Все планшеты помещали в климатическую камеру при температуре 23°C и относительной влажности 70%. Эксперимент был построен по полностью рандомизированной схеме.

Прорастание, происходившее с течением времени, регистрировали путем фотографирования в различных временных точках. Анализ изображений проводили автоматически с использованием макроса, разработанного с использованием программного обеспечения Image J. Кинетический анализ прорастания проводили путем построения кривой тренда. Из кривой тренда рассчитывали три параметра: T50 (время, необходимое для 50% прорастания, скорость прорастания); наклон кривой (равномерность прорастания) и плато (общий процент проросших семян).

Обработка изоциклосерамом при 3 концентрациях 1, 5 и 25 мкМ привела к значительным изменениям скорости прорастания, что указывает на неожиданный эффект изоциклосерама. Результаты выражены в процентах по сравнению с контролем (необработанные семена), и результаты анализируются статистически, чтобы выявить значимые различия ($p < 0,05$). (Ключ: Знач. = значимость)

Таблица 3. Сорт озимой пшеницы Syllon: прорастание при повышенном засолении

Обработка	Абиотический фактор стресса: повышенная соленость	Время, необходимое для достижения 50% прорастания пшеницы		
Концентрация изоциклосерама	Солевой раствор NaCl	Относительный T50	LSD	Знач.
Без обработки	12,5 мМ	100	/	/
1 мкМ	12,5 мМ	95,27	4,3	Быстрее
5 мкМ	12,5 мМ	94,70	4,3	Быстрее
25 мкМ	12,5 мМ	93,07	4,3	Быстрее

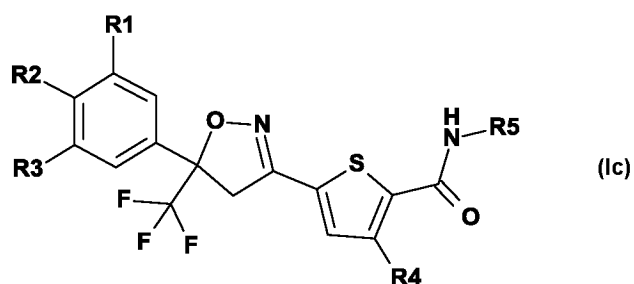
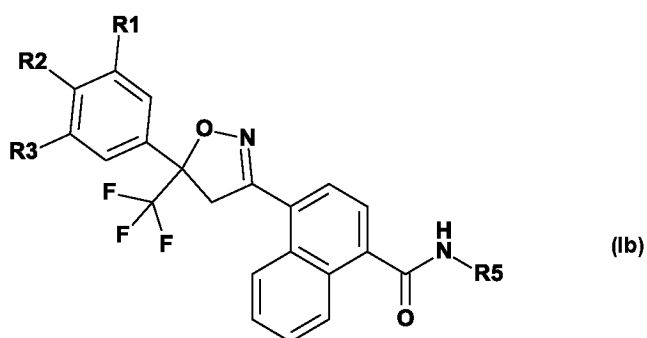
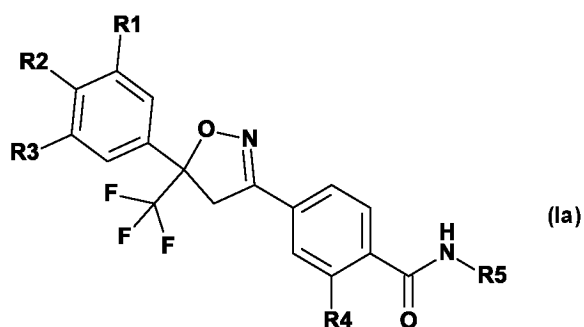
Параметр T50 соответствует времени, необходимому для прорастания половины популяции семян, и является параметром прорастания, имеющим большое

агрономическое значение. Значимые различия между обработанными семенами и необработанным контролем приведены при $p < 0,05$ (Anova). Более низкие значения указывают на более быстрое прорастание.

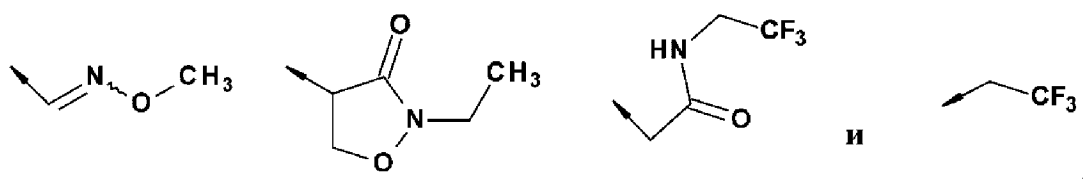
- 5 В условиях солевого стресса/повышения засоления скорость прорастания, выраженная как T50 при трех дозах 1, 5 и 25 мкМ, была значительно лучше, чем у необработанного контроля, что указывает на положительное влияние на скорость прорастания в условиях солевого стресса.

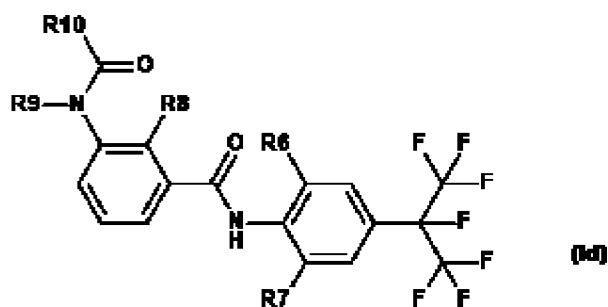
ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Способ улучшения сельскохозяйственной культуры путем применения по отношению к растениям, частям растений, материалу для размножения растений или к месту произрастания растений соединения формулы (I), которое
- 5 представляет собой соединение формулы (Ia), (Ib), (Ic), (Id), (Ie) или (If):



- 10 где каждый из R_1 , R_2 и R_3 независимо выбран из H, Cl, F, Br и CF_3 ;
каждый R_4 независимо выбран из CH_3 , Cl, Br и CF_3 ; и
каждый R_5 независимо выбран из



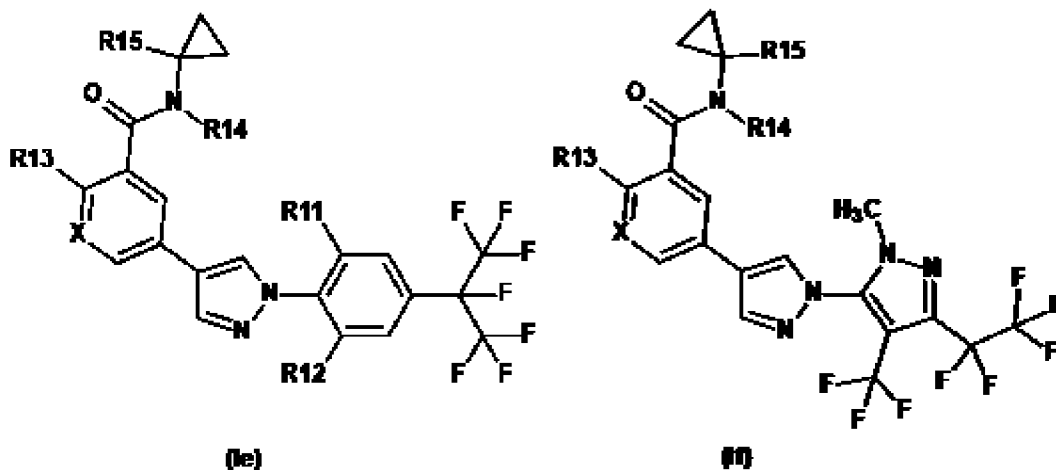


где каждый из R₆ и R₇ выбран из Cl, Br, CH₃, CH₂CH₃, CF₃ и OCF₂H;

R₈ выбран из F и OCH₃;

5 R₉ выбран из H, CH₃ и CH₂CH₃; и

R₁₀ представляет собой фенил, необязательно замещенный F или Cl;



10 где каждый из R₁₁ и R₁₂ выбран из Cl, Br, CH₃, CH₂CH₃, CF₃ и OCF₂H;

каждый R₁₃ независимо выбран из Cl и Br;

каждый R₁₄ независимо выбран из H, CH₃ и CH₂CH₃;

каждый R₁₅ независимо выбран из H и CN; и

каждый X независимо выбран из CH и N;

15 или композиции, содержащей соединение формулы (I).

2. Применение соединения формулы (I), указанного в п. 1, или композиции, содержащей соединение формулы (I), для улучшения сельскохозяйственной культуры.

3. Способ по п. 1 или применение по п. 2, где улучшение представляет собой увеличение устойчивости к абиотическим факторам стресса.
- 5 4. Способ или применение по п. 3, где абиотический фактор стресса выбран из засухи, воздействия низких температур, воздействия тепла, осмотического стресса, заболачивания, повышенной солености, повышенной концентрации минералов, воздействия озона, воздействия яркого света, ограниченной доступности азотных питательных веществ и ограниченной доступности фосфорных питательных веществ.
- 10 5. Способ или применение по п. 4, где абиотический фактор стресса представляет собой воздействие низких температур или повышенную соленость.
- 15 6. Способ или применение по любому из пп. 1-5, где сельскохозяйственная культура представляет собой зерновую культуру, бобовую культуру, канолу или кукурузу.
7. Способ или применение по п. 6, где сельскохозяйственная культура представляет собой пшеницу.
- 20 8. Способ или применение по п. 7, где соединение формулы (I) применяют при посеве в качестве обработки семени или почвы.
9. Способ или применение по п. 6, где сельскохозяйственная культура представляет собой кукурузу.
- 25 10. Способ или применение по любому из пп. 1-9, где сельскохозяйственная культура представляет собой сельскохозяйственную культуру трансгенных растений.
11. Способ или применение по любому из пп. 1-10, где соединение формулы (I) применяют в комбинации с фунгицидно активным соединением.
- 30 12. Способ или применение по любому из пп. 1-11, где соединение формулы (I) применяют до появления фактора стресса.

13. Способ или применение по любому из предыдущих пунктов, где соединение формулы (I) представляет собой изоциклосерам.