

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(21) **201900127** (13) **A1**

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2019.12.30

(22) Дата подачи заявки
2019.03.28

(51) Int. Cl. *A01N 37/18* (2006.01)
A01N 37/34 (2006.01)
A01N 43/52 (2006.01)
A01N 43/54 (2006.01)
A01N 53/10 (2006.01)

(54) ФУНГИЦИДНАЯ КОМПОЗИЦИЯ, ОБЛАДАЮЩАЯ СИНЕРГЕТИЧЕСКИМ ЭФФЕКТОМ

(31) **2018122646**

(32) **2018.06.21**

(33) **RU**

(71) Заявитель:
**АКЦИОНЕРНОЕ ОБЩЕСТВО
"ЩЕЛКОВО АГРОХИМ" (RU)**

(72) Изобретатель:
**Желтова Ксения Валентиновна,
Каракотов Салис Добаевич, Желтова
Елена Владимировна (RU)**

(74) Представитель:
Князева Л.А. (RU)

(57) Изобретение относится к сельскому хозяйству, а именно к комбинациям активных соединений, в частности к фунгицидной композиции, содержащей карбендазим, относящийся к классу бензимидазолов, и азоксистробин, относящийся к классу стробилуринов, проявляющей синергетический эффект, и может быть использовано в борьбе с заболеваниями сельскохозяйственных культур путем обработки вегетирующих растений. Техническим результатом является разработка синергетического состава для защиты сельскохозяйственных культур, высокоэффективная защита сельскохозяйственных культур от различных болезней на ранних фазах развития культуры; уменьшение кратности обработок растений, а также повышение эффективности воздействия на органы растений при совместном их использовании, обеспечение стабильности при хранении в течение не менее 2 лет с даты изготовления. Поставленная задача достигается за счет того, что предлагаемая фунгицидная композиция, обладающая синергетической активностью, для обработки сельскохозяйственных культур, включает смесь карбендазима с азоксистробином, при массовом соотношении карбендазим:азоксистробин (0,25-30):1.

A1

201900127

201900127

A1

Фунгицидная композиция, обладающая синергетической активностью

Изобретение относится к сельскому хозяйству, а именно к комбинациям активных соединений, в частности, к фунгицидной композиции, содержащей карбендазим, относящийся к классу бензимидазолов, и азоксистробин, относящийся к классу стробилуринов, проявляющей синергетический эффект и может быть использовано в борьбе с заболеваниями сельскохозяйственных культур путем обработки вегетирующих растений.

Болезнь растений, повреждающая сельскохозяйственные культуры, может вызывать значительное снижение продуктивности и в связи с этим приводить к повышенной стоимости для потребителя. Болезни растений зачастую сильно губительны, их тяжело контролировать, и они могут развивать резистентность к промышленным фунгицидам. Для этих целей доступно множество продуктов, однако остается потребность в новых фунгицидных композициях, которые являются более эффективными, менее дорогими, менее токсичными, более безопасными для окружающей среды. Определенные немногочисленные комбинации фунгицидов демонстрируют эффект, превосходящий аддитивный (т.е. синергический), что обеспечивает важные с промышленной точки зрения уровни контроля болезней растений и борьбу с ними. В соответствии с этим необходимы новые эффективные комбинации для обеспечения наилучших условий для получения максимальных урожаев.

Известен фунгицид карбендазим (БМК), который разрешен для борьбы с заболеваниями сельскохозяйственных растений при нормах расхода 0,6-1,6 кг/га (Мельников Н.Н. и др. Пестициды и регуляторы роста растений. Справочник. М.: Химия, 1995. С.251). Карбендазим (БМК) - фунгицид системного действия, имеет низкую токсичность, эффективен для борьбы с рядом заболеваний растений. Он разрешен для применения на территории РФ в виде концентрата суспензии (200 г/л или 500 г/л) для протравливания семян ржи, пшеницы, ячменя. А также используется в виде опрыскивания в период вегетации на пшенице, ячмене, ржи, сахарной свекле против корневой и прикорневой гнили, мучнистой росы, снежной плесени, стеблевой головни (Мельников Н.Н. Пестициды. Химия, технология и применение. М.: Химия, 1987. С 565).

Известно средство для защиты злаковых культур от бактериальных и грибных заболеваний (РФ 2409951), содержащее в качестве бактерицида комплекс стрептотрициновых соединений, образуемых *Str. griseus* или *Str. lavendulae*, и фунгицида карбендазима, а также растворители и функциональные добавки. В качестве загустителя средство содержит ксантановую камедь, в качестве диспергатора - сульфанол, а в качестве консерванта - бензиловый спирт. Недостатком данного средства является применение в составе стрептотрициновых соединений, которые вызывают у зерновых резистентность к возбудителям бактериоза.

Однако известные препараты эффективны при высоких нормах расхода, что отрицательно сказывается на состоянии окружающей среды.

Известен фунгицид Квадрис (азоксистробин 250 г/л), разрешенный к применению на территории РФ, выпускаемый ф. Сингента только для овощных культурах.

Также известен способ борьбы с фитопатогенными болезнями растений за счет использования смесового препарата, включающего **азоксистробин** и N-сульфонилвалинамид, взятые в синергетически эффективном количестве (РФ № 2270564).

Известна композиция для борьбы с фитопатогенными болезнями растений, включающая производное фенилпропаргильевый эфир и **азоксистробин** (РФ № 2259353).

Азоксистробин используется в фунгицидных композициях в сочетании с другими активными соединениями, часто в синергетически эффективных количествах. Например с производными пиридилэтилбензамида (РФ №2360417), с О-метилоксим метилового эфира 2-[α-{[(α-метил-3-трифторметил-бензил)имино]окси}орто-толил]глиоксиловой кислоты (РФ №282993), с амидным производным карбоновой кислоты (РФ №2483541), с производным 1,2,3-тиадиазола (РФ №2165144,) с карбоксамидным соединением (РФ №2558214) и другими соединениями, обладающими фунгицидной активностью (РФ №№2387133, 2595155, 2417590, 2192743, 2547554).

Наиболее близким техническим решением, принятым авторами в качестве прототипа, выбран известный препарат ЗИМ 500, КС (500 г/л карбендазима), являющийся системным фунгицидом для защиты зерновых культур, сахарной свеклы и других сельскохозяйственных культур от широкого спектра болезней, а также для протравливания семян зерновых культур (справочник пестицидов и агрохимикатов, разрешенных к применению на территории РФ, 2018, издательство Агрорус).

Задачей настоящего изобретения является расширение ассортимента эффективных фунгицидов применяемых в периода вегетации, приводящее к снижению фунгицидной нагрузки на окружающую среду, увеличению времени воздействия препарата на вредные объекты и увеличению длительности защиты.

Техническим результатом является разработка синергетического состава для защиты сельскохозяйственных культур, высокоэффективная защита сельскохозяйственных культур от различных болезней на ранних фазах развития культуры; уменьшение кратности обработок растений, а также повышение эффективности воздействия на органы растений при совместном их использовании, обеспечение стабильности при хранении в течение не менее 2 лет с даты изготовления.

Поставленная задача достигается за счет того, что предлагаемая фунгицидная композиция, обладающая синергетической активностью, для обработки сельскохозяйственных культур, включает смесь карбендазима с азоксистробин, при массовом соотношении карбендазим : азоксистробин (0,25-30) : 1.

Механизм действия активных соединений :

Карбендазим обладает защитным и лечащим действием. Действующее вещество поглощается листьями и корнями с преимущественным перемещением вверх. Тормозит процесс деления клеток патогенов. Системное действие позволяет защищать даже те участки больных растений, с которыми препарат не соприкасается. Благодаря лечебному (куративному) действию, фунгицид эффективно подавляет болезни даже после проявления их симптомов на растениях. *Азоксистробин* обладает системным и контактным действием с защитным и лечащим эффектом. Механизм действия обусловлен способностью вещества подавлять митохондриальное дыхание клеток патогенов, что приводит их к быстрой гибели.

Период защитного действия: совокупный период защиты составляет 4 недели с момента обработки. Карбендазим обладает защитным и куративным действием, период защитного действия до 3-х недель; защитное действие азоксистробина проявляется в течение 4 недель с момента обработки.

Предлагаемое изобретение иллюстрируется следующими опытами и примерами.

Лабораторные биологические испытания:

Вычисление фунгицидного синергического эффекта

Синергический эффект фунгицидов присутствует тогда, когда фунгицидная активность сочетаний активных соединений превосходит суммарные активности активных соединений, которые они проявляют при раздельном применении.

Ожидаемая активность для данного сочетания двух активных соединений может быть вычислена следующим образом (см. Colby, S. R., "Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations", Weeds 15, pages 20-22, 1967):

Экспериментальное исследование фунгицидной активности карбендазим, азоксистробин и их смесь проводилось на изоляте *Fusarium oxysporum* (фузариозная корневая гниль). Результаты исследований приведены в **таблице 1**.

Препарат вводился в картофельно-агаризованную среду. Состав среды: картофельный отвар (200 г/л), сахароза (15 г/л), агар (25 г/л).

Посев изолята проводился высечками 0,5×0,5 мм в чашки Петри на слой среды. Условия выращивания: в термостате при температуре 22°C.

Учет роста проводился на 4 и 10 сутки с момента посева путем измерения диаметра мицелия.

Скорость роста (СР) грибов рассчитывали как отношение диаметра роста мицелия в опытном варианте к контролю, выраженное в %. Эффективность (Э) рассчитывали как $\text{Э} = 100\% - \text{СР}$.

Повторность четырехкратная.

Ожидаемую эффективность $\text{Э}_{\text{ожд.}}$ рассчитывали по формуле Эбботта-Колби

$$\text{Э}_{\text{ожд.}} = A + B - \frac{A \times B}{100},$$

где А и В - эффективность для отдельно применяемых фунгицидов.

Если соотношение между экспериментально наблюдаемой эффективностью ($\text{Э}_{\text{эксп.}}$) и ожидаемой эффективностью ($\text{Э}_{\text{ожд.}}$) - синергетический фактор (СФ) - более 1, смесь проявляет синергетический эффект:

$$\text{СФ} = \frac{\text{Э}_{\text{эксп.}}}{\text{Э}_{\text{ожд.}}}$$

Таким образом, из приведенной таблицы 1 видно, что введение в смесь азоксистробина проявляет синергетический эффект против *Fusarium oxysporum*.

Аналогично были проведены экспериментальные исследования фунгицидной активности в отношении действия заявляемой композиции против *Microdochium nivale* (снежная плесень). Результаты исследований приведены в **таблице 2**. Таким образом, из приведенной таблицы 2 видно, что заявляемая композиция приводит к синергизму действия против *Microdochium nivale*.

Высокая биологическая активность комбинаций биологически активных веществ согласно данному изобретению видна из **таблицы 3** по отношению к *Drechslera teres* (сетчатая пятнистость). В то время как отдельные активные вещества обнаруживают недостаточную фунгицидную активность, заявленные комбинации проявляют активность, которая превышает ожидаемую эффективность, рассчитанную по формуле Эббота-Колби.

Пример 1. Получение фунгицидной композиции

Для получения 1 л композиции готовят водный премикс, содержащий 300 г карбендазима и 100 г азоксистробина при заявляемых соотношениях, тщательно перемешивают при температуре 14 – 18⁰С. Добавляют вспомогательные вещества. Перемешивания ведут до образования однородной суспензии.

Технология применения. Порядок приготовления рабочей жидкости.

Рабочую жидкость готовят непосредственно перед опрыскиванием. Бак опрыскивателя на 1/2 заполняют водой, заливают полную дозу препарата, затем доливают оставшееся количество воды и перемешивают. Перемешивание продолжается и во время обработки посевов для обеспечения однородности рабочей жидкости.

Полученной фунгицидной композицией из примера 1 обработали 1 гектар посевов сельскохозяйственных культур в фазу кущения. Выбираются обычные способы применения. Через 20 дней провели учет на уровень пораженности заболеваниями.

В опытах использовали каждое активное соединение в отдельности и в комбинации активных веществ.

Предлагаемая комбинация активных веществ малотоксична для обрабатываемых с/х культур. Согласно изобретению обрабатываться могут все растения и все части растений.

Комбинации активных веществ согласно изобретению могут применяться в виде их препаративных форм, таких как суспензий, суспо-эмульсий, водорастворимых гранул. Названные препаративные формы могут быть приготовлены известными способами, например, путем смешивания активных веществ, по крайней мере, с одним растворителем, разбавителем, эмульгатором, диспергирующим средством и/или связующим или фиксирующим средством, а также с другими распространенными добавками.

Изобретение иллюстрируется следующими примерами. Однако изобретение не ограничивается этими примерами.

Пример 2. Полевые мелкоделяночные испытания.

Эффективность заявленной фунгицидной композиции изучали на пшенице яровой в отношении *Blumeria graminis* (мучнистая роса) и *Pyrenophora tritici-repentis* (пиренофороз), на ячмене яровом в отношении *Pyrenophora teres* (сетчатая пятнистость) и *Rhynchosporium secalis* (ринхоспориоз), на сое в отношении *Ascochyta sojaecola* (аскохитоз) и *Cercospora sojae* (церкоспороз), на сахарной свекле в отношении *Cercospora beticola* (церкоспороз) и *Erysiphe betae* (мучнистая роса). Обработку проводили по вегетации при первых признаках заболевания, 4-кратная повторность, учет через 20 дней. Результаты биологических опытов сведены в **таблицу 4 - 7**.

При соблюдении рекомендуемых норм расхода композиция фитотоксичностью не обладает. При соблюдении рекомендуемых норм расхода и технологии использования композиции возникновения резистентности не наблюдалось.

Преимущества предлагаемой фунгицидной композиции: проявляет усиленный фунгицидный эффект за счет комбинации двух действующих веществ со взаимодополняющими биологическими свойствами; обеспечивает высокоэффективную защиту сельскохозяйственных культур от различных болезней; профилактические обработки предотвращают развитие листовых заболеваний в более поздний период развития культуры; обладает профилактическим, лечебным и искореняющим действием; различный механизм действия веществ, входящих в состав препарата, обуславливает гарантированную защиту и предупреждает проявление резистентных штаммов патогенов.

Таблица 1				
Фунгицидная активность препаратов при различных концентрациях по отношению к <i>Furasium oxysporum</i> (фузариозные корневые гнили)				
Активные компоненты	Доза, мл/л	Э _{эсп.}	Э _{ожид.}	СФ
азоксистробин	0,0002	20,1		
карбендазим	0,0002	29,7		
карбендазим + азоксистробин 1 : 1	0,0002+0,0002	56,1	43,8	1,28
азоксистробин	0,0001	18,2		
карбендазим	0,003	44,5		
карбендазим + азоксистробин 30 : 1	0,003 + 0,0001	73,7	54,6	1,35
азоксистробин	0,0008	43,5		
карбендазим	0,0002	27,8		
карбендазим + азоксистробин 0,25 : 1	0,0002 +0,0008	72,2	59,2	1,22

Таблица 2.				
Фунгицидная активность препаратов при различных концентрациях по отношению к <i>Microdochium nivale</i> (снежная плесень)				
Активные компоненты	Доза, мл/л	Э _{эсп.}	Э _{ожид.}	СФ
азоксистробин	0,0002	29,0		
карбендазим	0,0002	18,2		
карбендазим + азоксистробин 1 : 1	0,0002+0,0002	59,1	41,9	1,41
азоксистробин	0,0001	20,8		
карбендазим	0,003	29,1		
карбендазим + азоксистробин 30 : 1	0,003+0,0001	55,7	43,8	1,27
азоксистробин	0,0008	54,9		
карбендазим	0,0002	17,4		
карбендазим + азоксистробин 0,25 : 1	0,0002 +0,0008	84,1	62,7	1,34

Таблица 3				
Фунгицидная активность препаратов по отношению к <i>Drechslera teres</i> (сетчатая пятнистость)				
Активные компоненты	Доза, мл/л	Э _{эсп.}	Э _{ожид.}	СФ
азоксистробин	0,0002	23,8		
карбендазим	0,0002	47,1		
карбендазим + азоксистробин 1 : 1	0,0002+0,0002	79,4	59,7	1,33
азоксистробин	0,0001	20,1		
карбендазим	0,003	71,8		
карбендазим + азоксистробин 30 : 1	0,003+0,0001	100,0	77,5	1,29
азоксистробин	0,0008	44,5		
карбендазим	0,0002	44,8		
карбендазим + азоксистробин 0,25 : 1	0,0002 +0,0008	91,5	69,3	1,32

Таблица 4

Эффективность заявленной фунгицидной композиции (**пшеница яровая**) в условиях мелкоделяночных опытов. Обработка по вегетации в фазу начало выхода в трубку, 4-кратная повторность, учет через 20 дней

№№	Активные компоненты	Норма расхода Σ ДВ г/га	<i>Blumeria graminis</i>		<i>Pyrenophora tritici-repentis</i>	
			Развитие, %	Эффективность, %	Развитие, %	Эффективность, %
1	Азоксистробин	80	29	9,4	7	53,3
2	Азоксистробин	100	27	15,6	5	66,6
3	Карбендазим	240	13	59,4	12	20,0
4	Карбендазим	300	10	68,7	10	33,3
5	Карбендазим : азоксистробин 3 : 1	320	5	84,4	4	73,3
6	Карбендазим : азоксистробин 3 : 1	400	3	90,6	1	93,3
7	Контроль	-	32	-	15	-

Таблица 5

Эффективность заявленной фунгицидной композиции (**ячмень яровой**) в условиях мелкоделяночных опытов. Обработка по вегетации в фазу начало выхода в трубку, 4-кратная повторность, учет через 20 дней

№№	Активные компоненты	Норма расхода Σ ДВ г/га	<i>Pyrenophora teres</i>		<i>Rhynchosporium secalis</i>	
			Развитие, %	Эффективность, %	Развитие, %	Эффективность, %
1	Азоксистробин	80	25	37,5	18	33,3
2	Азоксистробин	100	19	52,5	15	44,4
3	Карбендазим	240	27	32,5	16	40,7
4	Карбендазим	300	22	45,0	12	55,5
5	Карбендазим : азоксистробин 3 : 1	320	15	62,5	10	62,9
6	Карбендазим : азоксистробин 3 : 1	400	9	77,5	6	77,7
7	Контроль	-	40	-	27	-

Таблица 6						
Эффективность заявленной фунгицидной композиции (соя) в условиях мелкоделяночных опытов. Обработка по вегетации в фазу бутонизации, 4-кратная повторность, учет через 20 дней						
№№	Активные компоненты	Норма расхода Σ ДВ г/га	<i>Ascochyta sojaecola</i>		<i>Cercospora sojae</i>	
			Развитие, %	Эффективность, %	Развитие, %	Эффективность, %
1	Азоксистробин	80	15	40,0	32	23,8
2	Азоксистробин	100	12	52,0	27	35,7
3	Карбендазим	240	18	28,0	25	40,5
4	Карбендазим	300	16	36,0	21	50,0
5	Карбендазим : азоксистробин 3: 1	320	10	60,0	15	64,3
6	Карбендазим : азоксистробин 3: 1	400	4,5	82,0	12	71,4
7	Контроль	-	25	-	42	-

Таблица 7						
Эффективность заявленной фунгицидной композиции (сахарная свекла) в условиях мелкоделяночных опытов. Обработка по вегетации, 4-кратная повторность, учет через 20 дней						
№№	Активные компоненты	Норма расхода Σ ДВ г/га	<i>Cercospora beticola</i>		<i>Erysiphe betae</i>	
			Развитие, %	Эффективность, %	Развитие, %	Эффективность, %
1	Азоксистробин	80	52	30,6	22	26,6
2	Азоксистробин	100	40	46,6	20	33,3
3	Карбендазим	240	37	50,6	14	53,3
4	Карбендазим	300	30	60,0	9	70,0
5	Карбендазим : азоксистробин 3 : 1	320	24	68,0	5	83,3
6	Карбендазим : азоксистробин 3 : 1	400	14	81,3	0	100,0
7	Контроль	-	75	-	30	

ФОРМУЛА

Фунгицидная композиция, обладающая синергетической активностью, для обработки сельскохозяйственных культур, включающая смесь карбендазима с другим фунгицидом, отличающаяся тем, что в качестве другого фунгицида используют азоксистробин, при массовом соотношении карбендазим : азоксистробин $(0,25 - 30) : 1$.

ЕВРАЗИЙСКОЕ ПАТЕНТНОЕ ВЕДОМСТВО

ОТЧЕТ О ПАТЕНТНОМ
ПОИСКЕ(статья 15(3) ЕАПК и правило 42
Патентной инструкции к ЕАПК)Номер евразийской заявки:
201900127

Дата подачи: 28 марта 2019 (28.03.2019) Дата испрашиваемого приоритета: 21 июня 2018 (21.06.2018)

Название изобретения: Фунгицидная композиция, обладающая синергетическим эффектом

Заявитель: АКЦИОНЕРНОЕ ОБЩЕСТВО "ЩЕЛКОВО АГРОХИМ"

☐ Некоторые пункты формулы не подлежат поиску (см. раздел I дополнительного листа)☐ Единство изобретения не соблюдено (см. раздел II дополнительного листа)

А. КЛАССИФИКАЦИЯ ПРЕДМЕТА ИЗОБРЕТЕНИЯ:

МПК: A01N 37/18 (2006.01)

СПК: A01N 37/18 (2017-08)

A01N 37/34 (2006.01)

A01N 37/34 (2013-01)

A01N 43/52 (2006.01)

A01N 43/52 (2013-01)

A01N 43/54 (2006.01)

A01N 43/54 (2013-01)

A01N 53/10 (2006.01)

Согласно Международной патентной классификации (МПК) или национальной классификации и МПК

Б. ОБЛАСТЬ ПОИСКА:

Минимум просмотренной документации (система классификации и индексы МПК)

A01N 37/18, 37/34, 43/52, 43/54, 53/10

Другая проверенная документация в той мере, в какой она включена в область поиска:

В. ДОКУМЕНТЫ, СЧИТАЮЩИЕСЯ РЕЛЕВАНТНЫМИ

Категория*	Ссылки на документы с указанием, где это возможно, релевантных частей	Относится к пункту №
A	WO 2010/043552 A1 (BASF SE et al.) 22.04.2010	1
A	WO 2011/095134 A1 (ROTAM AGROCHEM INTERNATIONAL CO., LTD. et al.) 11.08.2011	1
A	WO 2006/035316 A2 (SYGENTA PARTICIPATIONS AG et al.) 06.04.2006	1

☐ последующие документы указаны в продолжении графы В☐ данные о патентах-аналогах указаны в приложении

* Особые категории ссылочных документов:

"А" документ, определяющий общий уровень техники

"Е" более ранний документ, но опубликованный на дату подачи евразийской заявки или после нее

"О" документ, относящийся к устному раскрытию, экспонированию и т.д.

"Р" документ, опубликованный до даты подачи евразийской заявки, но после даты испрашиваемого приоритета

"D" документ, приведенный в евразийской заявке

"Т" более поздний документ, опубликованный после даты

приоритета и приведенный для понимания изобретения

"Х" документ, имеющий наиболее близкое отношение к предмету поиска, порочащий новизну или изобретательский уровень, взятый в отдельности

"У" документ, имеющий наиболее близкое отношение к предмету поиска, порочащий изобретательский уровень в сочетании с другими документами той же категории

"&" документ, являющийся патентом-аналогом

"L" документ, приведенный в других целях

Дата действительного завершения патентного поиска: 12 августа 2019 (12.08.2019)

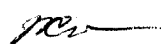
Наименование и адрес Международного поискового органа:

Федеральный институт

промышленной собственности

РФ, 125993, Москва, Г-59, ГСП-3, Бережковская наб.,
д. 30-1. Факс: (499) 243-3337, телетайп: 114818 ПОДАЧА

Уполномоченное лицо :



Ю.В. Жилина

Телефон № (499) 240-25-91