

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(21) **202000094** (13) **A1**

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2021.03.31

(22) Дата подачи заявки
2020.03.12

(51) Int. Cl. *A01N 43/54* (2006.01)
A01N 43/653 (2006.01)
A01N 47/26 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)

**(54) ФУНГИЦИДНАЯ КОМПОЗИЦИЯ ДЛЯ ПРОТРАВЛИВАНИЯ СЕМЯН
ЗЕРНОБОБОВЫХ КУЛЬТУР И ПОДСОЛНЕЧНИКА**

(31) 2019127653

(32) 2019.09.03

(33) RU

(71) Заявитель:
АО "ЩЕЛКОВО АГРОХИМ" (RU)

(72) Изобретатель:
**Желтова Елена Владимировна,
Каракотов Салис Добаевич, Таланова
Ксения Валентиновна, Сараев Павел
Викторович, Божко Кира Николаевна,
Голубева Наталья 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 азоксистробин, относящийся к классу стробилуринов, тебуконазол, относящийся к классу азолов, и тирам, относящийся к классу дитиокарбаматов, проявляющей синергетический эффект, и может быть использовано в борьбе с заболеваниями зернобобовых культур, подсолнечника путем протравливания семян перед посевом против семенной и почвенной инфекций, в том числе против пыльной головни. Техническим результатом является разработка синергетического состава для протравливания семян сельскохозяйственных культур; высокоэффективная защита сельскохозяйственных культур от различных болезней на ранних фазах развития культуры; сведение к минимуму внесения листовых фунгицидов; обеспечение стабильности композиции при хранении в течение не менее двух лет с даты изготовления. Поставленная задача достигается за счет того, что предлагаемая фунгицидная композиция, обладающая синергетической активностью, для обработки сельскохозяйственных культур включает смесь тебуконазола с азоксистробином при дополнительном внесении тирама в синергетических количествах, при массовом соотношении тебуконазол 0,17-5:азоксистробин 1:тирам 2-100.

A1

202000094

202000094

A1

Фунгицидная композиция для протравливания семян зернобобовых культур и подсолнечника

Изобретение относится к сельскому хозяйству, а именно к комбинациям активных соединений, в частности, к фунгицидной композиции, содержащей азоксистробин, относящийся к классу стробилуринов, тебуконазол, относящийся к классу азолов и тирам, относящийся к классу дитиокарбаматов, проявляющей синергетический эффект, и может быть использовано в борьбе с заболеваниями зернобобовых культур, подсолнечника путем протравливания семян перед посевом против семенной и почвенной инфекции, в том числе против пыльной головки.

Азоксистробин, сложный метиловый эфир 2-{2-[6-(2-циано-1-винилпента-1,3-динилокси)-пиримидин-4-илокси]фенил}-3-метоксиакриловой кислоты, 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. Высокоэффективен против возбудителей ложной и мучнистой настоящей росы, а также против рас возбудителя, устойчивых к производным триазолов.

Тебуконазол, 1-(4-хлорфенил)-4,4-диметил-3-[1,2,4]триазол-1-илметилпентан-3-ол, обладает системным и защитным действием. Обладает искореняющим и терапевтическим действием. Является ингибитором деметилирования стероидов в биосинтезе эргостерона. Фунгицид предназначен для борьбы с различными грибными заболеваниями зерновых, бобовых, садовых, овощных и многих других культур.

Тирам, бис-диметилтиокарбамоил)дисульфит, контактный фунгицид защитного действия, не проникающий в растения или семена и подавляющий прорастание спор или начальный рост мицелия патогена, находящегося на поверхности. Проникая в клетки возбудителя, он ингибирует активность ферментов, содержащих атомы меди или сульфгидрильные группы. Тирам не эффективен для борьбы с внутренней инфекцией головки (пыльная головня пшеницы, ячменя) и головными болезнями пленчатых культур (овес, ячмень, просо). На растениях сохраняется 1-1,5 месяца после обработки. Активно подавляет развитие патогенов из класса оомицетов и частично базидиомицетов, поражающих надземную массу и семена 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. В соответствии с этим необходимы новые эффективные комбинации для обеспечения наилучших условий для получения максимальных урожаев.

Известна синергетическая композиция **ЕА014115**, включающая **тебуконазол и мефеноксам для обработки семян**. Массовое соотношение двух активных ингредиентов, содержащихся в композиции составляет от 2000:1 до 1:1000.

Известна фунгицидная смесь (ЕА №011813), содержащая в качестве активных компонентов: 1) диметиламид 3-(3-бром-6-фтор-2-метилиндол-1-сульфонил)-[1,2,4]триазол-1-сульфокислоты формулы IА и 2) по меньшей мере одно действующее вещество, выбранное из группы, включающее: азоксистробин в синергически эффективном количестве. Кроме того, вышеуказанная смесь может дополнительно содержать действующее вещество из групп: азолы, такие как тебуконазол, дитиокарбаматы, такие как тирам, Эффективны против патогенных грибов. Вносится последовательно или вместе. Опрыскивание растений, протравочный и почвенный фунгици.

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

Известен фунгицид Тир ТПС (400 тирам + 25 тебуконазол, г/л), разрешенный к применению на территории РФ для борьбы с вредителями зерновых культур.

Известна композиция для борьбы с фитопатогенными болезнями растений, включающая производное фенилпропаргиловый 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 карбендазимом (пат.РФ №2681739), 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 N-сульфонилвалинамид (РФ № 2270564), с карбоксамидным соединением (РФ №2558214) и другими соединениями,

обладающими фунгицидной активностью (РФ №№ 2387133, 2595155, 2417590, 2192743, 2547554,).

Для расширения спектра действия и усиления биологической активности тебуконазол используют в различных смесевых препаратах (пат. РФ №№2024228, 2192743, 2040899, 2232504).

Известна фунгицидная композиция (РФ 2527024), содержащая производное тетразолиллоксима (А) и (В) фунгицидное соединение, выбранное из списка, состоящего из азоксистробина в качестве ингибитора дыхания и тебуконазола в качестве ингибитора биосинтеза эргостерола, при массовом отношении А/В в диапазоне от 1/0,01 до 1/100, предназначенная для защиты растений, сельскохозяйственных культур или семян против грибных заболеваний.

Наиболее близким техническим решением, принятым авторами в качестве прототипа, выбран пат.РФ № 2426312, в котором описана композиция, состоящая из тебуконазола, азоксистробина и другого соединения изопиразама. Композицию применяют на полезных растениях, их местоположении или материале для их размножения против фитопатогенных грибов.

При учете снижения норм расхода и расширения спектра действия известных соединений в основу настоящего изобретения была положена задача разработки смесей, которые по возможности при малых общих количествах расходуемых действующих веществ, проявляют улучшенное действие против патогенных грибов. В соответствии с этим были разработаны вышеприведенные смеси. Было установлено, что при одновременном совместном применении соединения действующих веществ можно лучше бороться с патогенными грибами.

В основу настоящего изобретения была положена задача разработки композиции, которая проявляет улучшенное действие против патогенных грибов. В соответствии с этим были разработаны композиции из трех действующих веществ из различных химических групп с различным механизмом действия. Кроме того, было установлено, что при одновременном совместном применении тебуконазола, азоксистробина и тирама можно лучше бороться с корневыми гнилями, снежной плесенью, гнилями подсолнечника, фузариозом и аскохитозом бобовых при проявлении трех действующих веществ синергического эффекта.

Смеси согласно изобретению могут переводиться в обычные препаративные формы, например растворы, эмульсии, суспензии, порошки, тонкие порошки, пасты и грануляты.

Форма применения ориентируется на цель применения. Она в любом случае должна обеспечивать тонкое и равномерное распределение соединений согласно изобретению.

Отдельно действующее вещества из предлагаемой синергетической смеси обычно применяются в количестве: азоксистробин 10-40 г/т, тебуконазол 10-40 г/т тирам 200-800 г/т. В предлагаемой композиции препарата (тебуконазол : азоксистробин : тирам, г/т) оптимальное весовом соотношении от (0,17-5) : 1 : (2-100). Нормы расхода композиции составляют 280-560 г/т.

Задачей настоящего изобретения является расширение ассортимента эффективных фунгицидов, применяемых при протравливании семян зернобобовых, подсолнечника и других культур для борьбы с фитопатогенными микроорганизмами, усилению воздействия препарата на вредные объекты и увеличению длительности защиты.

Техническим результатом является разработка синергетического состава для протравливания семян сельскохозяйственных культур, высокоэффективная защита сельскохозяйственных культур от различных болезней на ранних фазах развития культуры; сведения к минимуму внесения листовых фунгицидов, обеспечение стабильности композиции 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 тебуконазола с азоксистробином при дополнительном внесении тирама в синергетических количествах, при массовом соотношении тебуконазол 0,17-5 : азоксистробин 1 : тирам 2-100

Изобретение поясняется следующими примерами.

Пример 1. Получение фунгицидной композиции

Для получения 1 л композиции готовят водный премикс, содержащий 25г тебуконазола, 15 г азоксистробина и 400 г тирама, тщательно перемешивают при температуре 14 – 18⁰С. Добавляют вспомогательные вещества. Перемешивания ведут до образования однородного продукта.

Рабочий раствор готовили непосредственно перед обработкой семян. Заполнили бак водой и при непрерывном перемешивании вылили необходимое количество препарата в бак. Обработку семян рекомендуется проводить на протравочных

машинах типа ПС-10 или на аналогичных машинах, предназначенных для жидких препаратов.

Полученной фунгицидной композицией протравили 100 кг семян. Выбираются обычные способы применения. Через 20 дней провели учет на уровень пораженности заболеваниями.

В опытах использовали двухкомпонентную смесь (тебуконазол и азоксистробин) и ее смесь с тирамом.

Предлагаемая композиция активных веществ малотоксична, предлагается для проведения протравливания семян.

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 Определение синергетического эффекта.

Ожидаемую эффективность $\mathcal{E}_{\text{ожид.}}$ рассчитывали по формуле Эбботта-Колби

$$\mathcal{E}_{\text{ожид.}} = A + B - \frac{A \times B}{100},$$

где А и В - эффективность для отдельно применяемых фунгицидов.

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

$$\text{СФ} = \frac{\mathcal{E}_{\text{эксп.}}}{\mathcal{E}_{\text{ожид.}}}$$

Чашка Петри диаметром 86 мм. Площадь чашки 0,0058 кв.м. Норма расхода рабочей жидкости 300 л/га; т.е. норма расхода на 1 чашку Петри – 174 мкл/чашка (см.таблицу 1-6)

Пример 3. Полевые мелкоделяночные испытания на пшенице

Результаты полевых опытов сведены в **таблице 7**.

Эффективность препарата заявленного препарата, КС (15+25+400 г/л) против пыльной головни на пшенице яровой (сорт Альбидум 43). Ленинградская область, 2018 г.

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

Аналогичные испытания были проведены на ячмене, сое, горохе и подсолнечнике.

Преимущества предлагаемой фунгицидной композиции: проявляет усиленный фунгицидный эффект за счет комбинации трех 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.

Комбинации активных ингредиентов, предлагаемые в настоящем изобретении обладают полезными характеристиками, обеспечивающими защиту растений от заражения патогенными и непатогенными бактериями, в особенности грибными, которые приводят к болезни и повреждению растения, именно гельминтоспориозная корневая гниль, фузариозная корневая гниль, аскохитоз, фомопсис, серая гниль, церкоспороз.

Таблица 1. Заболевание *Bipolaris sorokiniana* (гельминтоспориозная корневая гниль)

	Активные компоненты	Доза, г ДВ/т	Соотношение ДВ	Э _{эксп.}	Э _{ожд.}	СФ
1	Тебуконазол	10	0,17:1:2	61,6		
	Азоксистробин	60				
	Тирам	120				
	Тебуконазол	10				
	Азоксистробин	60				
	Тирам	120		84,6	73,6	1.15
2	Тебуконазол	40	5:1:100	42.1		
	Азоксистробин	8				
	Тирам	400				
	Тебуконазол	40				
	Азоксистробин	8				
	Тирам	400		71,8	64.2	1.12
3	Тебуконазол	25	1,56:1:26,6	45.8		
	Азоксистробин	15				
	Тирам	400				
	Тебуконазол	25				
	Азоксистробин	15				
	Тирам	400		73.1	67.0	1.09

Таблица 2. Заболевание *Fusarium Oxysporum* (фузариозная корневая гниль)

	Активные компоненты	Доза, г ДВ/т	Соотношение ДВ	Э _{эксп.}	Э _{ожид.}	СФ
1	Тебуконазол	30	0,17:1:2	65.1	754	1.12
	Азоксистробин	180		29.6		
	Тирам	360		81.4		
	Тебуконазол	30		32.2		
2	Азоксистробин	4	5:1:100	60.0	56.5	1.06
	Тирам	400		35.8		
	Тебуконазол	20		36.0		
	Азоксистробин	4		36.3		
3	Тебуконазол	25	1,56:1:26,6	64.5	59.2	1.09
	Азоксистробин	15		64.5		
	Тирам	400		59.2		
	Тебуконазол	25		59.2		

Таблица 3. Заболевание *Ascochyta rabiei* (аскохитоз)

	Активные компоненты	Доза, г ДВ/т	Соотношение ДВ	Э _{эсп.}	Э _{ожид.}	СФ
1	Тебуконазол	30		65.2		
	Азоксистробин	180				
	Тирам	360		27.5		
	Тебуконазол	30	0,17:1:2	78.6	74.8	1.05
	Азоксистробин	180				
	Тирам	360				
2	Тебуконазол	20		19.8		
	Азоксистробин	4				
	Тирам	400		33.1		
	Тебуконазол	20	5:1:100	53.3	46.3	1.15
	Азоксистробин	4				
	Тирам	400				
3	Тебуконазол	25		24.3		
	Азоксистробин	15				
	Тирам	400		33.9		
	Тебуконазол	25	1,56:1:26,6	58.9	50.0	1.18
	Азоксистробин	15				
	Тирам	400				

Таблица 4. Заболевание *Phomopsis helianthi* (фомопсис)

	Активные компоненты	Доза, г ДВ/т	Соотношение ДВ	Э _{эсп.}	Э _{ожид.}	СФ
1	Тебуконазол	30		50.2		
	Азоксистробин	180				
	Тирам	360		55.4		
	Тебуконазол	30	0,17:1:2	86.4	77.8	1.11
	Азоксистробин	180				
	Тирам	360				
2	Тебуконазол	20		16.2		
	Азоксистробин	4				
	Тирам	400		60.2		
	Тебуконазол	20	5:1:100	75.3	66.6	1.13
	Азоксистробин	4				
	Тирам	400				
3	Тебуконазол	25		21.4		
	Азоксистробин	15				
	Тирам	400		59.5		
	Тебуконазол	25	1,56:1:26,6	77.0	68.2	1.13
	Азоксистробин	15				
	Тирам	400				

Таблица 5. Заболевание *Botrytis cinerea* (серая гниль)

	Активные компоненты	Доза, г ДВ/га	Соотношение ДВ	Э _{эксп.}	Э _{ожд.}	СФ
1	Тебуконазол	30	0,17:1:2	48.2	78.8	1.06
	Азоксистробин	180				
	Тирам	360		59.1		
	Тебуконазол	30		83.5		
	Азоксистробин	180				
	Тирам	360				
2	Тебуконазол	20	5:1:100	41.3	81.3	1.08
	Азоксистробин	4				
	Тирам	400		68.2		
	Тебуконазол	20		87.8		
	Азоксистробин	4				
	Тирам	400				
3	Тебуконазол	25	1,56:1:26,6	46.4	83.1	1.08
	Азоксистробин	15				
	Тирам	400		68.4		
	Тебуконазол	25		89.7		
	Азоксистробин	15				
	Тирам	400				

Таблица 6. Заболевание *Cercospora beticola* (церкоспороз)

	Активные компоненты	Доза, г ДВ/га	Соотношение ДВ	Э _{эксп.}	Э _{ожд.}	СФ
1	Тебуконазол	30	0,17:1:2	58.4	70.1	1.10
	Азоксистробин	180				
	Тирам	360		28.1		
	Тебуконазол	30		77.1		
	Азоксистробин	180				
	Тирам	360				
2	Тебуконазол	20	5:1:100	48.9	65.5	1.12
	Азоксистробин	4				
	Тирам	400		32.5		
	Тебуконазол	20		73.4		
	Азоксистробин	4				
	Тирам	400				
3	Тебуконазол	25	1,56:1:26,6	51.5	67.5	1.07
	Азоксистробин	15				
	Тирам	400		33.0		
	Тебуконазол	25		72.2		
	Азоксистробин	15				
	Тирам	400				

Таблица 7 Эффективность заявленной композиции (15+25+400 г/л) против пыльной головки на пшенице яровой (сорт Альбидум 43)

Вариант опыта	Норма примене ния препара та, л/т	Полевая всхо- жесть семян, %	Дата обработки:		Кол-во продук- тивных стеблей, шт./м ²	Масса 1000 зерен, г	Урожайность	
			17.05.					
			USTITR					
			10.07.					
			Пораже ние, %	эффек- тивность, %			ц/га	% к конт- ролю
Композиция тебуконазол 25 + азоксистробин 15+ тирам 400 г/л)	0,8	81,3	0.33	77.2	413	35,3	15.9	116.1
Композиция тебуконазол 25 + азоксистробин 15+ тирам 400 г/л)	1,2	82.3	0.23	84.1	413	34.5	15.2	110.9
Смесь тебуконазол 25 + азоксистробин 15 г/л	1.2	69.8	0.69	52.4	402	34.5	14.0	102.2
-Тирам 400г/л	1.2	71.0	0.78	46.2	398	34.2	13.8	100.7
Контроль (без обработки)	-	67.3	1.45	-	392	34.9	13.7	100.0

Примечание: USTITR- *ustilago tritici* (пыльная головня)

ФОРМУЛА

Фунгицидная композиция для протравливания семенного материала сельскохозяйственных культур, включающая смесь тебуконазола и азоксистробина с другим фунгицидом, отличающаяся тем, что в качестве другого фунгицида используют тирам, при массовом соотношении тебуконазол : азоксистробин: тирам $(0.17-5) : 1 : (2-100)$

ОТЧЕТ О ПАТЕНТНОМ ПОИСКЕ

(статья 15(3) ЕАПК и правило 42 Патентной инструкции к ЕАПК)

Номер евразийской заявки:

202000094**А. КЛАССИФИКАЦИЯ ПРЕДМЕТА ИЗОБРЕТЕНИЯ:***A01N 43/54 (2006.01)**A01N 43/653 (2006.01)**A01N 47/26 (2006.01)**A01P 3/00 (2006.01)*

Согласно Международной патентной классификации (МПК)

Б. ОБЛАСТЬ ПОИСКА:

Просмотренная документация (система классификации и индексы МПК)

A01N 43/54, A01N 43/653, A01N 47/26, A01P 3/00

Электронная база данных, использовавшаяся при поиске (название базы и, если, возможно, используемые поисковые термины)
EAPATIS, ESPACENET, PATENTSCOPE, REAXYS**В. ДОКУМЕНТЫ, СЧИТАЮЩИЕСЯ РЕЛЕВАНТНЫМИ**

Категория*	Ссылки на документы с указанием, где это возможно, релевантных частей	Относится к пункту №
A	RU 2426312 C2 (СИНДЖЕНТА ПАРТИСИПЕЙШНС АГ) 2011.08.20, описание, формула	1
A	EA 013409 B1 (ЗИНГЕНТА ПАРТИСИПЕЙШНС АГ) 30.06.2008, описание, формула	1
A	WO 2013/186325 A1 (STICHTING I-F PRODUCT COLLABORATION) 2013.12.19, описание, формула	1
A	Zhang Y.J. et al. Quantification of Fusarium graminearum in Harvested Grain by Real-Time Polymerase Chain Reaction to Assess Efficacies of Fungicides on Fusarium Head Blight, Deoxynivalenol Contamination, and Yield of Winter Wheat. PHYTOPATHOLOGY. 2009, Vol. 99, No. 1, pp.95-100. Найдено в REAXYS https://apsjournals.apsnet.org/doi/10.1094/PHYTO-99-1-0095 <doi.org/10.1094/PHYTO-99-1-0095>, реферат, таблица 1	1

☐ последующие документы указаны в продолжении

* Особые категории ссылочных документов:

«А» - документ, определяющий общий уровень техники

«D» - документ, приведенный в евразийской заявке

«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"

«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

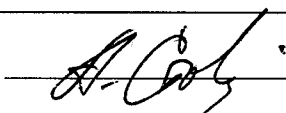
«L» - документ, приведенный в других целях

Дата проведения патентного поиска: **29/05/2020**

Уполномоченное лицо:

Заместитель начальника Управления экспертизы

Начальник отдела химии и медицины

 А.В. Чебан