

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(21) **202100210** (13) **A1**

(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ**

(43) Дата публикации заявки
2022.12.30

(51) Int. Cl. *A01N 43/653* (2006.01)
A01N 47/24 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)

(22) Дата подачи заявки
2021.08.16

(54) **СИНЕРГЕТИЧЕСКАЯ ФУНГИЦИДНАЯ КОМБИНАЦИЯ БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫХ ВЕЩЕСТВ**

(31) **2021118672**

(32) **2021.06.28**

(33) **RU**

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

(72) Изобретатель:

**Каракотов Салис Добаевич, Желтова
Елена Владимировна, Таланова
Ксения Валентиновна, Сараев Павел
Викторович, Черненькая Лидия
Николаевна, Салмина Екатерина
Сергеевна (RU)**

(57) Изобретение относится к сельскому хозяйству. Синергетическая фунгицидная комбинация содержит тебуконазол, дифеноконазол и пиракlostробин. Изобретение позволяет повысить биологическую эффективность и гарантирует повышенную надежность в борьбе с болезнями сельскохозяйственных культур. Полученный технический результат - получение синергетического эффекта против различных болезней и повышение биологической эффективности. Технический результат достигается тем, что синергетическая фунгицидная комбинация биологически активных веществ содержит тебуконазол (I), соединение из класса стробилуринов (II) и дополнительное соединение из класса триазолов (III), где в качестве соединения (II) из класса стробилуринов используют пиракlostробин, а в качестве дополнительного соединения (III) из класса триазолов используют дифеноконазол, причем соединения (I), (II) и (III) используют в синергетически эффективном весовом соотношении $(0,1 \div 10):(0,1 \div 10):1$.

A1

202100210

202100210

A1

Синергетическая фунгицидная комбинация биологически активных веществ

Изобретение относится к сельскому хозяйству. Синергетическая фунгицидная комбинация содержит тебуконазол, дифеноконазол и пираклостробин. Изобретение позволяет повысить биологическую эффективность и гарантирует повышенную надежность в борьбе с болезнями сельскохозяйственных культур.

Различные соединения разных химических классов хорошо известны как пестициды для растений, применяющиеся для различных культур возделываемых растений. Однако переносимость культурами и активность по отношению к фитопатогенным грибам, поражающим растения, во многих случаях и во многих отношениях не всегда соответствует потребностям сельскохозяйственной практики.

Постоянно необходимы пестицидные комбинации, которые обеспечивают улучшение биологической эффективности, в особенности для борьбы с патогенами и вредителями для сельскохозяйственных культур.

Существует много причин, по которым смешиваются средства защиты растений. К ним относятся:

- Многочисленность вредных объектов, наносящих вред сельскохозяйственным культурам. В связи с этим используют несколько средств защиты с разным спектром действия.

- Комбинация средств защиты растений может увеличить продолжительность контроля (например, быстродействующее вещество в сочетании с более медленнодействующим веществом). Сочетание двух или более действующих веществ может привести к синергизму. Синергизм может привести к снижению пестицидной нагрузки на окружающую среду, снижение затрат у потребителя или производителя, поскольку можно использовать более низкие гектарные нормы расхода каждого из действующих веществ в смеси, но при этом обеспечить эффективный контроль.

- Вредные объекты сельскохозяйственных культур - это динамичные популяции. Динамика, "выживания наиболее приспособленных", может привести к снижению восприимчивости вредных объектов к средствам защиты растений. Устойчивость к продуктам химических средств защиты растений - это сценарий, который негативно влияет как на потребителя пестицидов, так и на компании по их производству. Один из способов помочь справиться с этим "сопротивлением" - применять продукты с различными спектрами действия.

Известно, что для борьбы с болезнями растений применяют фунгициды из класса триазолов и стробилуринов и их смеси.

Дифеноконазол (1-[2-[2-хлор-4-(4-хлорфенокси)фенил]-4-метил-1,3-диоксолан-2-илметил]-1H-1,2,4-триазол) представляет собой фунгицид из класса триазолов, который является эффективным в отношении ряда заболеваний, вызванных аскомицетами, базидиомицетами и дейтеромицетами. Дифеноконазол описан в The Pesticide Manual, 2018.

Пиракlostробин представляет собой тривиальное наименование для метил [2-[[[1-(4-хлорфенил)-1H-пиразол-3-ил]окси]метил]фенил]метоксикарбамата. Его фунгицидная активность описывается в The Pesticide Manual, 2018. Пиракlostробин контролирует большинство патогенов растений, таких как *Septoria tritici*, *Puccinia* spp., *Drechslera tritici-repentis* и *Pyrenophora teres*, у зерновых культур и других сельскохозяйственных культур. Данный фунгицид находится в классе стробилуринов.

Тебуконазол - α -[2-(4-хлорфенил)этил]- α -(1,1-диметилэтил)-1H-1,2,4-триазол-1-этанола. Его фунгицидное действие описано в The Pesticide Manual, 2018. Тебуконазол является коммерческим фунгицидом из класса триазолов, который используется для борьбы с грибными заболеваниями различных сельскохозяйственных культур, в частности, у зерновых, бобовых, подсолнечника, кукурузы, рапса, винограда, семечковых плодовых растений, косточковых плодовых растений и других культур.

В результате проведенных патентных исследований были отобраны следующие патенты.

Известна пестицидная синергетическая смесь (**RU2608048**), содержащая в качестве активных компонентов 1) одно фунгицидное соединение IA, выбранное из группы: пиракlostробин, дифеноконазол, тебуконазол или др., или 2) одно инсектицидное соединение IB, выбранное из группы: бифентрин, тефлутрин или др., и 3) *Bacillus subtilis* MBI600 в качестве соединения II, где весовое соотношение соединения I к соединению II составляет от 1 : 500 до 500 : 1.

Также известна трехкомпонентная пестицидная смесь (**EA018323**), включающая в качестве активных компонентов, взятых в синергетически эффективном количестве: 1) антраниламидсульфамойльное соединение, которое представляет собой 3-бром-4'-циано-1-(3-хлор-2-пиридил)-2'-метил-6'-(метилкарбамоил)пиразол-5-карбокسانيлид или 3-бром-4'-хлор-1-(3-хлор-2-пиридил)-2'-метил-6'-(метилкарбамоил)пиразол-5-карбокسانيлид; 2) пиракlostробин (соединение II) и 3) одно фунгицидное соединение (III), выбранное из группы азолов: дифеноконазол, тебуконазол, метконазол или др., где антраниламидсульфамойльное соединение и пиракlostробин находятся в массовом соотношении от 100 : 1 до 1 : 100.

Наиболее близкой к заявленной комбинации является фунгицидная комбинация биологически активных веществ (**RU2370034**), содержащая флукастробин (I) и

протиоконазол (II) и тебуконазол (III), причем соединения (I), (II) и (III) взяты в синергетически эффективном весовом соотношении (I) к активному веществу формулы (II) составляет 1:1 и к активному веществу формулы (III) составляет от 1:0,1 до 1:1.

Общим недостатком известных композиций является их низкая биологическая активность.

Задачей изобретения является расширение ассортимента эффективных фунгицидных комбинации, применяющих при защите сельскохозяйственных культур от фитопатогенных микроорганизмов и грибов, обладающей широким спектром биологической эффективности и повышенную надежность в борьбе с болезнями сельскохозяйственных культур.

Полученный технический результат – получение синергетического эффекта против различных болезней и повышение биологической эффективности.

Технический результат достигается тем, что синергетическая фунгицидная комбинация биологически активных веществ, содержит тебуконазол (I), соединение из класса стробилуринов (II) и дополнительное соединение из класса триазолов (III), где в качестве соединения (II) из класса стробилуринов используют пиракlostробин, а в качестве дополнительного соединения (III) из класса триазолов используют дифеноконазол, причем соединения (I), (II) и (III) используют в синергетически эффективном весовом соотношении $(0,1 \div 10) : (0,1 \div 10) : 1$.

Заявляемые комбинации эффективны, в частности, но не ограничиваются ими, для борьбы со следующими болезнями растений: *Phoma betae*, *Alternariaster helianthi*, *Fusarium* spp., мучнистая роса, церкоспороз, фомоз, альтернариоз на сахарной свекле, оидиум, милдью, серая гниль, черная пятнистость на винограднике, парша, пенициллезная гниль, альтернариоз, кладоспориоз при хранении плодов яблони, парша, филлостиктоз, плодовая гниль на яблоне, аскохитоз, антракноз сои, ржавчина, мучнистая роса гороха, пирикулярноз риса.

Заявляемая фунгицидная комбинация может применяться в различных формах, например, но, не ограничиваясь ими, в виде концентратов, в виде растворов для непосредственного опрыскивания, суспензий, включая также концентрированные водные, или безводные суспензии, или в виде микроэмульсии, причем для обработки используют самые различные методы, такие как опрыскивание, мелкокапельное опрыскивание и другие методы обработки. Эти формы и методы определяются целями применения, но во всех случаях должно быть обеспечено максимально равномерное и тонкое распределение действующих веществ, описываемых изобретением.

Синергизм возникает, когда вещества, смешанные вместе, дают больший, чем ожидалось, уровень активности. Типичным методом оценки синергизма является уравнение Колби (Colby, 1967). (см. пример 1)

Пример 1: Лабораторные испытания

Методика проведения опыта: экспериментальное исследование фунгицидной и фунгистатической активности образцов проводилось методом агаровых высечек. Для анализа готовили рабочие растворы образцов с концентрацией, которая определялась полевой нормой расхода действующих веществ с учетом нормы расхода рабочей жидкости. Для получения сравнительных данных и исключения достижения максимальной эффективности норму расхода уменьшали в 5 раз. Затем в стерильные чашки Петри раскапывали по 180 мкл рабочего раствора фунгицида (гектарные нормы расхода рабочего раствора пересчитывали на площадь поверхности чашки Петри с диаметром 87 мм), разливали предварительно простерилизованную и остывшую до 45°C питательную среду КСА и перемешивали до полного смешивания среды и препарата. После застывания агара в центр каждой чашки помещали блоки грибов диаметром 1 см, вырезанные с помощью стерильного пробойника. Повторность опыта 3-кратная. Термостатировали при температуре от 8-25°C в течение 7-20 суток (в зависимости от скорости роста грибов), после чего регистрировали наличие или отсутствие зон разрастания мицелия вокруг агаровых блоков и сравнивали с контролем.

Скорость роста грибов рассчитывали как отношение диаметра роста мицелия в опытном варианте к контролю, выраженное в %.

Биологическая активность действующих веществ и их смеси рассчитывали по следующей формуле: 100% - (скорость роста).

Повторность - 4-х кратная.

Ожидаемую эффективность $\mathcal{E}_{\text{ожид}}$ рассчитывали по формуле Колби:

$$\mathcal{E}_{\text{ожид}} = A + B + C - \frac{AB+AC+BC}{100} + \frac{ABC}{10000},$$

где

A, B и C – наблюдаемая эффективность для отдельно применяемых фунгицидов при указанной дозе в г/га;

$\mathcal{E}_{\text{ожид}}$ – ожидаемый результат для смеси трех фунгицидов;

$\mathcal{E}_{\text{эксп}}$ – полученный в результате эксперимента результат.

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

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

Этот синергетический эффект гарантирует повышенную надежность в борьбе с болезнями сельскохозяйственных культур, приводя к значительному снижению количества активного компонента, требуемого для достижения такого же биологического эффекта, либо сохранению нормы расхода действующего вещества при одновременном увеличении биологической эффективности. Результаты представлены в таблицах 1-3.

Пример 2: Полевые мелкоделяночные испытания

Эффективность заявленной композиции изучали в полевых условиях на сахарной свекле, подсолнечнике и сое. Однако изобретение не ограничивается только этими культурами. Результаты испытаний приведены в таблицах 4-6.

Таблица 1. Биологическая активность образцов против возбудителя фомоза свеклы *Phoma betae*

Образец	Норма расхода, г ДВ/га	Э эксп	Э ожид	СФ
Тебуконазол (Т)	20	9,8		
Пираклостробин (П)	20	7,3		
Дифеноконазол (Д)	200	26,0		
Т:П:Д=0,1:0,1:1		56,1	48,45	1,16
Тебуконазол (Т)	200	28,1		
Пираклостробин (П)	200	11,6		
Дифеноконазол (Д)	20	2,5		
Т:П:Д=10:10:1		55,6	46,53	1,19
Тебуконазол (Т)	100	22,1		
Пираклостробин (П)	100	10,7		
Дифеноконазол (Д)	50	4,8		
Т:П:Д=2:2:1		43,8	41,65	1,05
Тебуконазол (Т)	20	8,5		
Пираклостробин (П)	150	11,1		
Дифеноконазол (Д)	50	5,0		
Т:П:Д=0,4:3:1		34,7	26,57	1,31
Тебуконазол (Т)	180	27,8		
Пираклостробин (П)	50	9,7		
Дифеноконазол (Д)	50	4,9		
Т:П:Д=3,6:1:1		52,3	47,06	1,11

Таблица 2. Биологическая активность образцов против возбудителя альтернариоза подсолнечника *Alternariaster helianthi*

Образец	Норма расхода, г ДВ/га	Э эксп	Э ожд	СФ
Тебуконазол (Т)	20	8,6		
Пираклостробин (П)	20	9,9		
Дифеноконазол (Д)	200	19,8		
Т:П:Д=0,1:0,1:1		47,7	42,98	1,11
Тебуконазол (Т)	200	33,9		
Пираклостробин (П)	200	16,1		
Дифеноконазол (Д)	20	6,8		
Т:П:Д=10:10:1		69,5	66,03	1,05
Тебуконазол (Т)	100	23,6		
Пираклостробин (П)	100	14,0		
Дифеноконазол (Д)	50	10,1		
Т:П:Д=2:2:1		67,3	55,13	1,22
Тебуконазол (Т)	20	8,4		
Пираклостробин (П)	150	15,5		
Дифеноконазол (Д)	50	10,5		
Т:П:Д=0,4:3:1		44,2	38,35	1,15
Тебуконазол (Т)	180	28,9		
Пираклостробин (П)	50	11,0		
Дифеноконазол (Д)	50	9,8		
Т:П:Д=3,6:1:1		61,1	57,10	1,07

Таблица 3. Биологическая активность образцов против возбудителя фузариозного увядания сои *Fusarium spp.*

Образец	Норма расхода, г ДВ/га	Э эксп	Э ожид	СФ
Тебуконазол (Т)	20	9,9		
Пираклостробин (П)	20	11,4		
Дифеноконазол (Д)	200	12,6		
Т:П:Д=0,1:0,1:1		42,3	37,85	1,12
Тебуконазол (Т)	200	26,4		
Пираклостробин (П)	200	24,4		
Дифеноконазол (Д)	20	6,6		
Т:П:Д=10:10:1		70,4	67,62	1,04
Тебуконазол (Т)	100	18,2		
Пираклостробин (П)	100	18,8		
Дифеноконазол (Д)	50	8,1		
Т:П:Д=2:2:1		60,6	51,8	1,17
Тебуконазол (Т)	20	11,7		
Пираклостробин (П)	150	21,0		
Дифеноконазол (Д)	50	8,8		
Т:П:Д=0,4:3:1		55,5	47,05	1,18
Тебуконазол (Т)	180	24,8		
Пираклостробин (П)	50	15,5		
Дифеноконазол (Д)	50	9,0		
Т:П:Д=3,6:1:1		58,9	57,12	1,03

Таблица 4. Эффективность заявляемой композиции против *Cercospora beticola* (церкоспороз) на сахарной свекле – Воронежская область

Наименование образца	Норма действующих веществ, г/га	Соотношение ДВ	Развитие, %	Эффективность через 24 дня после обработки, %	Урожайность, ц/га
Тебуконазол Пираклостробин Дифеноконазол	100 100 50	2:2:1	2,8	83,0	582
Тебуконазол Пираклостробин Дифеноконазол	10 100 140	0,07:0,7:1	6,2	62,4	518
Контроль без обработки	-	-	16,5	-	486

Таблица 5. Эффективность заявляемой композиции против *Russinia helianthi* (ржавчина) на подсолнечнике – Волгоградская область

Наименование образца	Норма действующих веществ, г/га	Соотношение ДВ	Развитие, %	Эффективность через 30 дней после обработки, %	Урожайность, ц/га
Тебуконазол Пиракlostробин Дифеноконазол	100 100 50	2:2:1	5,6	61,6	32,1
Тебуконазол Пиракlostробин Дифеноконазол	10 100 140	0,07:0,7:1	8,1	44,5	29,4
Контроль без обработки	-	-	14,6	-	25,4

Таблица 6. Эффективность заявляемой композиции против *Ascochyta sojicola* (аскохитоз) на сое – Орловская область

Наименование образца	Норма действующих веществ, г/га	Соотношение ДВ	Развитие, %	Эффективность через 30 дней после обработки, %	Урожайность, ц/га
Тебуконазол Пиракlostробин Дифеноконазол	100 100 50	2:2:1	5,4	69,7	23,4
Тебуконазол Пиракlostробин Дифеноконазол	10 100 140	0,07:0,7:1	11,8	33,7	22,0
Контроль без обработки	-	-	17,8	-	20,9

Формула изобретения:

Синергетическая фунгицидная комбинация биологически активных веществ, содержащая тебуконазол (I), соединение из класса стробилуринов (II) и дополнительное соединение из класса триазолов (III), отличающаяся тем, что в качестве соединения (II) из класса стробилуринов используют пиракlostробин, а в качестве дополнительного соединения (III) из класса триазолов используют дифеноконазол, причем соединения (I), (II) и (III) используют в синергетически эффективном весовом соотношении $(0,1 \div 10) : (0,1 \div 10) : 1$.

ОТЧЕТ О ПАТЕНТНОМ ПОИСКЕ
(статья 15(3) ЕАПК и правило 42 Патентной инструкции к ЕАПК)

Номер евразийской заявки:

202100210

А. КЛАССИФИКАЦИЯ ПРЕДМЕТА ИЗОБРЕТЕНИЯ:

A01N 43/653 (2006.01)

A01N 47/24 (2006.01)

A01P 3/00 (2006.01)

Согласно Международной патентной классификации (МПК)

Б. ОБЛАСТЬ ПОИСКА:

Просмотренная документация (система классификации и индексы МПК)

A01N 43/653, 47/24, A01P 3/00

Электронная база данных, использовавшаяся при поиске (название базы и, если, возможно, используемые поисковые термины)
EAPATIS, PATENTSCOPE, ESPACENET, Google

В. ДОКУМЕНТЫ, СЧИТАЮЩИЕСЯ РЕЛЕВАНТНЫМИ

Категория*	Ссылки на документы с указанием, где это возможно, релевантных частей	Относится к пункту №
X	МИНСЕЛЬХОЗ РОССИИ. Свидетельство о государственной регистрации пестицида или агрохимиката №2802 от 16 сентября 2020 [онлайн] [найдено 2021-12-03]. Найдено в < https://betaren.ru/catalog/sredstva-zashchity-rasteniy/fungitsidy/misteriya-me/ >	1
Y	WO2017162567 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG) 2017-09-28 весь документ	1
Y	CN 103548857 A (SHAANXI KANGHE LIFENG BIOTECHNOLOGY PHARMACEUTICAL CO., LTD) 2014-02-05 реферат	1
A	WO2019215593 A1 (INDOFIL INDUSTRIES LIMITED) 2019-11-14 весь документ, в частности, с.21 таблица 5	1
A	US 20100144725 A1 (SYNGENTA CROP PROTECTION, INC.) 2010-06-10 формула п.11	1

последующие документы указаны в продолжении

* Особые категории ссылочных документов:

«А» - документ, определяющий общий уровень техники

«D» - документ, приведенный в евразийской заявке

«E» - более ранний документ, но опубликованный на дату подачи евразийской заявки или после нее

«O» - документ, относящийся к устному раскрытию, экспонированию и т.д.

"P" - 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

«X» - документ, имеющий наиболее близкое отношение к предмету поиска, порочащий новизну или изобретательский уровень, взятый в отдельности

«Y» - документ, имеющий наиболее близкое отношение к предмету поиска, порочащий изобретательский уровень в сочетании с другими документами той же категории

«&» - документ, являющийся патентом-аналогом

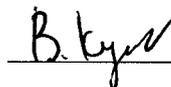
«L» - документ, приведенный в других целях

Дата проведения патентного поиска: **07/12/2021**

Уполномоченное лицо:

Заместитель начальника Управления экспертизы

Начальник отдела химии и медицины



А.В. Чебан