

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(11) **044479**

(13) **B1**

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ

(45) Дата публикации и выдачи патента
2023.08.30

(21) Номер заявки
202091234

(22) Дата подачи заявки
2018.11.13

(51) Int. Cl. *A01N 37/34* (2006.01)
A01N 37/44 (2006.01)
A01N 43/36 (2006.01)
A01N 43/54 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01N 43/653 (2006.01)
A01N 43/82 (2006.01)
A01N 43/84 (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01)
A01N 45/02 (2006.01)
A01N 37/36 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)
A01N 59/02 (2006.01)
A01N 63/00 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)

(54) ФУНГИЦИДНЫЕ КОМПОЗИЦИИ

(31) 17202875.5

(32) 2017.11.21

(33) EP

(43) 2020.10.05

(86) PCT/EP2018/081112

(87) WO 2019/101580 2019.05.31

(71)(73) Заявитель и патентовладелец:
**ЗИНГЕНТА ПАРТИСИПЕЙШНС АГ
(CH)**

(72) Изобретатель:
Блюм Матиас (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)**

(56) WO-A1-2016122802
US-A1-2011082160
WO-A1-2018204435
WO-A1-2018204436
WO-A1-2018204437

(57) Фунгицидная композиция, содержащая компоненты (А) и (В), где компонент (А) представляет собой соединение формулы (I), определенное в п.1 формулы изобретения, компонент (В) представляет собой пидифлуметофен, где весовое соотношение (А) и (В) составляет от 10:1 до 1:10, применение композиции, в качестве фунгицида и в способе контроля заболеваний полезных растений или их материала для размножения, вызванных фитопатогенами, предпочтительно грибами.

044479 B1

044479 B1

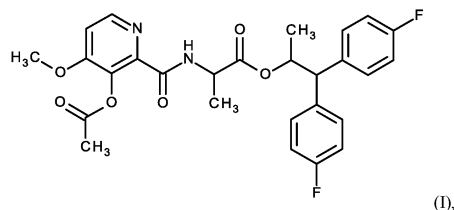
Изобретение относится к новым фунгицидным композициям для лечения фитопатогенных заболеваний полезных растений, особенно вызванных фитопатогенными грибами, и к способу контроля таких заболеваний и/или грибов на полезных растениях.

В WO 2016/122802 и WO 2016/109257 раскрыты определенные пиколинамидные соединения и их варианты применения в качестве фунгицидов, включая (1S)-2,2-бис(4-фторфенил)-1-метилэтил-N-{{3-(ацетилокси)-4-метокси-2-пиридил}карбонил}-L-аланинат. В заявках WO 2018/204437, WO 2018/204435 и WO 2018/204436 раскрыты определенные фунгицидные композиции, содержащие (1S)-2,2-бис(4-фторфенил)-1-метилэтил-N-{{3-(ацетилокси)-4-метокси-2-пиридил}карбонил}-L-аланинат в комбинации с другим фунгицидным активным ингредиентом.

При этом множество фунгицидных соединений и композиций, относящихся к различным отличающимся химическим классам, было разработано/продолжает разрабатываться для применения в качестве фунгицидов в сельскохозяйственных культурах полезных растений, толерантность сельскохозяйственных культур и активность в отношении определенных фитопатогенных грибов не всегда удовлетворяют потребности сельскохозяйственной практики во многих отношениях. Следовательно, существует постоянная потребность в поиске новых соединений и композиций, характеризующихся превосходными биологическими свойствами в отношении применения для контроля или предупреждения заражения растений фитопатогенными грибами. Например, соединения, обладающие более высокой биологической активностью, предпочтительным спектром активности, повышенным профилем безопасности, улучшенными физико-химическими свойствами, повышенной биоразлагаемостью. Или иначе, композиции, обладающие более широким спектром активности, улучшенной толерантностью сельскохозяйственных культур, синергическими взаимодействиями или потенцирующими свойствами, или композиции, которые демонстрируют более быстрое начало действия, или которые характеризуются более длительной остаточной активностью, или которые обеспечивают снижение количества внесений и/или снижение нормы внесения соединений и композиций, необходимых для эффективного контроля фитопатогена, обеспечивают, таким образом, целесообразную предпочтительную практику контроля устойчивости, снижение влияния на окружающую среду и снижение воздействия на оператора.

Применение композиций, содержащих смеси различных фунгицидных соединений, характеризующихся различными механизмами действия, может удовлетворять некоторые из таких потребностей (например, посредством объединения фунгицидов с отличающимися спектрами активности).

В соответствии с настоящим изобретением предусмотрена фунгицидная композиция, содержащая компоненты (A) и (B) в качестве активных ингредиентов, где компонент (A) представляет собой соединение формулы (I),



или его агрохимически приемлемую соль, N-оксид, диастереоизомер, энантиомер или таутомер; и компонент (B) представляет собой пидифлуметофен, где весовое соотношение (A) и (B) составляет от 10:1 до 1:10.

Дополнительно в соответствии с настоящим изобретением предусмотрен способ контроля заболеваний полезных растений или их материала для размножения, вызванных фитопатогенами, который включает применение композиции, определенной в соответствии с настоящим изобретением, по отношению к полезным растениям, или месту их произрастания, или материалу для их размножения.

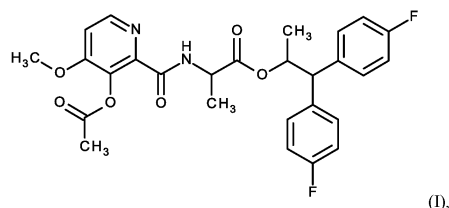
Кроме того, в соответствии с настоящим изобретением предусмотрено применение композиции, содержащей компонент (A) и компонент (B), определенные в соответствии с настоящим изобретением, в качестве фунгицида.

Было обнаружено, что применение соединения в виде компонента (B) в комбинации с соединением формулы (I) (или соединением формулы (IA)) на удивление и в значительной степени может повышать эффективность последнего в отношении грибов, и наоборот. Дополнительно применение композиций по настоящему изобретению может быть эффективным в отношении более широкого спектра таких грибов, чем спектр, с которым можно вести борьбу в случае применения отдельных активных ингредиентов по отдельности.

Преимущества, предусмотренные определенными композициями фунгицидных смесей в соответствии с настоящим изобретением, могут также включать *inter alia* предпочтительные уровни биологической активности для защиты растений от заболеваний, которые вызваны грибами, или превосходные свойства для применения в качестве агрохимических активных ингредиентов (например, более высокая биологическая активность, предпочтительный спектр активности, повышенный профиль безопасности, улучшенные физико-химические свойства или повышенная биоразлагаемость).

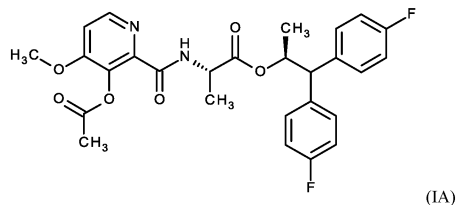
Компонент (A) в композициях по настоящему изобретению представляет собой соединение форму-

лы (I),



(I),

или его агрохимически приемлемую соль, N-оксид, диастереоизомер, энантиомер или таутомер или соединение формулы (IA),



(IA),

или его агрохимически приемлемую соль, N-оксид или таутомер.

Соединение формулы (IA) представляет собой (1S)-2,2-бис(4-фторфенил)-1-метилэтил-N-{{3-(ацетилокси)-4-метокси-2-пиридил}карбонил}-L-аланинат (флорилпикоксамид).

В каждом случае соединения формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением находятся в свободной форме, в окисленной форме в виде N-оксида или в форме соли, например, в форме агрономически применимой соли. N-оксиды представляют собой окисленные формы третичных аминов или окисленные формы азотсодержащих гетероароматических соединений. Они описаны, например, в книге "Heterocyclic N-oxides" by A. Albini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991.

Соединение компонента (B) упоминается в данном документе выше посредством так называемого "общепринятого названия согласно ISO" или другого "общепринятого названия", используемого в отдельных случаях, или с помощью названия торговой марки. Соединение компонента (B) известно и является коммерчески доступными и/или может быть получено с применением процедур, известных из уровня техники, и/или процедур, описанных в литературе.

Компонент (B) (регистрационный номер по CAS в скобках) в композициях по настоящему изобретению представляет собой пидифлуметофен [1228284-64-7].

В предпочтительной композиции в соответствии с настоящим изобретением: компонент (A) представляет собой соединение формулы (IA) или его агрохимически приемлемую соль, N-оксид или таутомер, и компонент (B) представляет собой пидифлуметофен, где весовое соотношение компонента (A) и компонента (B) составляет от 5:1 до 1:5.

В еще более предпочтительных композициях в соответствии с настоящим изобретением:

компонент (A) представляет собой соединение формулы (IA), и компонент (B) представляет собой пидифлуметофен,

где весовое соотношение компонента (A) и компонента (B) составляет от 5:1 до 1:5.

Любая из предпочтительных фунгицидных композиций в соответствии с настоящим изобретением может, в частности, применяться для контроля заболевания, вызванного определенными фитопатогенами на определенных полезных растениях, как указано далее:

Septoria tritici на пшенице; *Puccinia recondita* на пшенице;

Puccinia striiformis на пшенице;

Erysiphe graminis на пшенице;

Sphaerotheca fuliginea на огурце/тыквенных;

Mycosphaerella arachidis на арахисе;

Mycosphaerella fijiensis на банане;

Cercospora sp. на сое;

Pyricularia oryzae на рисе;

Pyrenophora teres на ячмене;

Ramularia collo-cygni на ячмене;

Rhynchosporium secalis на ячмене;

Colletotrichum lagenarium на огурце/тыквенных;

Uncinula necator на винограде;

Venturia inaequalis на яблоке;

Phakopsora pachyrhizi на сое.

Композиции по изобретению могут содержать, необязательно и другие соединения, раскрытые в заявке WO 2016/156085, выбранное из соединений: 1-(4,5-диметилбензимидазол-1-ил)-4,4,6-трифтор-3,3-диметил-изохинолина, 6-хлор-1-(4,5-диметилбензимидазол-1-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметил-изохинолина, 6-хлор-4,4-дифтор-1-(5-фтор-4-метил-бензимидазол-1-ил)-3,3-диметил-изохинолина, 6-

хлор-4,4-дифтор-3,3-диметил-1-(4-метилбензимидазол-1-ил)изохинолина, 4,4-дифтор-1-(5-фтор-4-метилбензимидазол-1-ил)-3,3-диметил-изохинолина, 1-(4,5-диметилбензимидазол-1-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметил-изохинолина, 4,4,5-трифтор-3,3-диметил-1-(4-метилбензимидазол-1-ил)изохинолина, 1-(4,5-диметилбензимидазол-1-ил)-4,4,5-трифтор-3,3-диметил-изохинолина, 1-(4,5-диметилбензимидазол-1-ил)-5-фтор-3,3,4,4-тетраметил-изохинолина, 4,4-дифтор-3,3-диметил-1-(4-метилбензимидазол-1-ил)изохинолина, 5-фтор-3,3,4,4-тетраметил-1-(4-метилбензимидазол-1-ил)изохинолина;

заявке WO 2017/025510, выбранное из соединений: 1-(6-хлор-7-метил-пиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметил-изохинолина, 4,4-дифтор-1-(6-фтор-7-метил-пиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)-3,3-диметил-изохинолина, 1-(6-хлорпиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметил-изохинолина, 1-(6-этилпиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметил-изохинолина, 4,4-дифтор-3,3-диметил-1-(6-метилпиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)изохинолина, 1-(6-бромпиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметил-изохинолина, 1-(6-бром-7-метил-пиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметил-изохинолина, 1-(6,7-диметилпиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)-4,4,6-трифтор-3,3-диметил-изохинолина, 1-(6,7-диметилпиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)-4,4,5-трифтор-3,3-диметил-изохинолина, 4,4-дифтор-3,3-диметил-1-(7-метилпиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)изохинолина, 1-(6,7-диметилпиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметил-изохинолина, 1-(6,7-диметилпиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)-5-фтор-3,3,4,4-тетраметил-изохинолина, 5-фтор-3,3,4,4-тетраметил-1-(7-метилпиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)изохинолина, 1-(7,8-диметилимидазо[1,2-а]пиридин-3-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметил-изохинолина, 4,4-дифтор-3,3-диметил-1-(7-метилимидазо[1,2-а]пиридин-3-ил)изохинолина, 1-(7,8-диметилимидазо[1,2-а]пиридин-3-ил)-5-фтор-3,3,4,4-тетраметил-изохинолина, 4,4-дифтор-3,3-диметил-1-(8-метилимидазо[1,2-а]пиридин-3-ил)изохинолина, 5-фтор-3,3,4,4-тетраметил-1-(7-метилимидазо[1,2-а]пиридин-3-ил)изохинолина, 5-фтор-3,3,4,4-тетраметил-1-(8-метилимидазо[1,2-а]пиридин-3-ил)изохинолина;

заявке WO 2017/153380, выбранное из соединений: N-(1-бензил-3-хлор-1-метил-бут-3-енил)-8-фтор-хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (R)-энантиомера), N-(1-бензил-1,3-диметил-бутил)-8-фтор-хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (R)-энантиомера), N-[1-бензил-1-метил-2-(1-метилциклопропил)этил]-8-фтор-хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (R)-энантиомера), N-(1-бензил-3,3,3-трифтор-1-метил-пропил)-8-метил-хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (R)-энантиомера), N-(1-бензил-3,3,3-трифтор-1-метил-пропил)-8-хлор-хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (R)-энантиомера), N-(1-бензил-3,3,3-трифтор-1-метил-пропил)-8-фтор-хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (R)-энантиомера), N-(1-бензил-3,3,3-трифтор-1-метил-пропил)-7,8-дифтор-хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (R)-энантиомера), N-(1-бензил-1,3-диметил-бутил)-7,8-дифтор-хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (R)-энантиомера), N-(1-бензил-1,3-диметил-бут-3-енил)-8-фтор-хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (R)-энантиомера), N-(1-бензил-1,3-диметил-бут-3-енил)-7,8-дифтор-хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (R)-энантиомера), 8-фтор-N-[1-[(3-фторфенил)метил]-1,3-диметил-бутил]хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (R)-энантиомера), 8-фтор-N-[3,3,3-трифтор-1-[(3-фторфенил)метил]-1-метил-пропил]хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (R)-энантиомера), N-[1-бензил-2-(1-фторциклопропил)-1-метил-этил]-8-фтор-хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (R)-энантиомера), N-(1-бензил-3,3-дифтор-1-метил-бутил)-8-фтор-хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (R)-энантиомера), N-(1-бензил-3-фтор-1,3-диметил-бутил)-8-фтор-хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (R)-энантиомера), N-(1-бензил-1,3,3-триметил-бутил)-8-фтор-хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (S)-энантиомера), N-(1-бензил-1,3-диметил-бутил)-8-метил-хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (S)-энантиомера), N-(1-бензил-1,3-диметил-бутил)-8-хлор-хинолин-3-карбоксамид, N-(1-бензил-1,3-диметил-бутил)хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (R)-энантиомера), N-(1-бензил-3,3,3-трифтор-1-метил-пропил)хинолин-3-карбоксамид (или его (S)-энантиомера или (R)-энантиомера);

заявке WO 2015/155075, выбранное из соединений N'-[5-бром-2-метил-6-[(1S)-1-метил-2-пропокси-этокси]-3-пиридил]-N-этил-N-метил-формамидина, N'-[5-бром-2-метил-6-[(1R)-1-метил-2-пропокси-этокси]-3-пиридил]-N-этил-N-метил-формамидина, N'-[6-(2-аллилокси-1-метил-этокси)-5-хлор-2-метил-3-пиридил]-N-этил-N-метил-формамидина, N'-[5-циано-2-метил-6-(1-метил-2-пропокси-этокси)-3-пиридил]-N-этил-N-метил-формамидина, N'-[5-хлор-2-метил-6-(1-метил-2-пропокси-этокси)-3-пиридил]-N-этил-N-метил-формамидина, N'-[5-(диформетил)-2-метил-6-(1-метил-2-пропокси-этокси)-3-пиридил]-N-этил-N-метил-формамидина, N'-[5-бром-2-метил-6-(1-метил-2-пропокси-этокси)-3-пиридил]-N'-изопропил-N-метил-формамидина, N'-[2,5-диметил-6-(1-метил-2-пропокси-этокси)-3-пиридил]-N-этил-N-метил-формамидина; или

заявке WO 2017/102635, выбранное из соединений N'-[4-[(3E)-3-этоксимино-1-гидрокси-1-(триформетил)бутил]-5-метокси-2-метил-фенил]-N-этил-N-метил-формамидина, N'-[4-[1-(бутоксиметил)-2,2,2-трифтор-1-гидрокси-этил]-5-метокси-2-метил-фенил]-N-этил-N-метил-формамидина, N'-[4-(1-циклопропил-2,2,2-трифтор-1-гидрокси-этил)-5-метокси-2-метил-фенил]-N-изопропил-N-метил-формамидина, N'-[4-[1-(циклобутилметоксиметил)-2,2,2-трифтор-1-гидрокси-этил]-

5-метокси-2-метил-фенил]-N-этил-N-метил-формамидина, N'-[4-[1-(циклопентоксиметил)-2,2,2-трифтор-1-гидрокси-этил]-5-метокси-2-метил-фенил]-N-этил-N-метил-формамидина, N'-[4-[1-гидрокси-3-метил-1-(трифторметил)бут-3-енил]-5-метокси-2-метил-фенил]-N-изопропил-N-метил-формамидина, N'-[4-[1-гидрокси-1-(трифторметил)пентил]-5-метокси-2-метил-фенил]-N-изопропил-N-метил-формамидина, N-изопропил-N'-[5-метокси-2-метил-4-(2,2,2-трифтор-1-гидрокси-1-фенил-этил)фенил]-N-метил-формамидина, N-этил-N'-[5-метокси-2-метил-4-[2,2,2-трифтор-1-гидрокси-1-(о-толил)этил]фенил]-N-метил-формамидина, N'-[4-[1-(3,5-дифторфенил)-2,2,2-трифтор-1-гидрокси-этил]-5-метокси-2-метил-фенил]-N-этил-N-метил-формамидина,

где весовое соотношение компонента (А) и указанного компонента (как раскрыто в WO 2016/156085, WO 2017/025510, WO 2017/153380, WO 2015/155075 или WO 2017/102635) составляет от 10:1 до 1:10 или от 5:1 до 1:5.

Как правило, весовое соотношение компонента (А) и компонента (В) в композициях по настоящему изобретению составляет от 10:1 до 1:10, наиболее предпочтительно от 5:1 и 1:5 и, в частности, от 5:2 до 2:5. Конкретные отдельные соотношения, которые являются предпочтительными, включают соотношение, составляющее 1:1, 5:1, 5:2, 5:3, 5:4, 4:1, 4:2, 4:3, 3:1, 3:2, 2:1, 1:5, 2:5, 3:5, 4:5, 1:4, 2:4, 3:4, 1:3, 2:3, 1:2, 1:10. Из них 1:10, 1:5 и 2:5 могут быть особенно предпочтительными.

Неожиданно было обнаружено, что определенные весовые соотношения компонента (А) и компонента (В) способны приводить к обеспечению синергической активности. Следовательно, дополнительный аспект настоящего изобретения представляет собой композиции, где компонент (А) и компонент (В) присутствуют в композиции в количествах, вызывающих синергический эффект. Данная синергическая активность очевидна из того факта, что фунгицидная активность композиции, содержащей компонент (А) и компонент (В) больше суммы фунгицидных активностей компонента (А) и компонента (В). Данная синергическая активность расширяет диапазон действия компонента (А) и компонента (В) двумя способами. Во-первых, нормы внесения компонента (А) и компонента (В) снижаются, при этом эффективность остается столь же высокой, то есть смесь активных ингредиентов по-прежнему достигает высокой степени контроля фитопатогенов, даже в том случае, когда два отдельных компонента стали бы совсем неэффективными при таком низком диапазоне нормы внесения. Во-вторых, наблюдается значительное расширение спектра фитопатогенов, который можно контролировать.

Синергический эффект наблюдается всякий раз, когда эффективность комбинации активных ингредиентов выше, чем сумма значений эффективности отдельных компонентов. Расчетная эффективность E для заданной комбинации активных ингредиентов подчиняется так называемой формуле Колби и может быть рассчитана следующим образом (COLBY, S.R. "Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide combination", Weeds, Vol. 15, pages 20-22; 1967):

ppm = миллиграмм активного ингредиента (= а.и.) на литр смеси для опрыскивания,

X = % эффективности активного ингредиента (А) при применении p ppm активного ингредиента,

Y = % эффективности активного ингредиента (В) при применении q ppm активного ингредиента.

Согласно COLBY расчетная (аддитивная) эффективность активных ингредиентов (А)+(В) при применении p+q ppm активных ингредиентов составляет:

$$E = X + Y - \frac{X \cdot Y}{100}$$

Если фактически наблюдаемая эффективность (О) больше, чем расчетная эффективность (Е), то эффективность комбинации является супераддитивной, т.е. наблюдается синергический эффект. В математических терминах синергизм соответствует положительному значению разности (О-Е). В случае только дополнительного сложения показателей активности (ожидаемая активность), указанная разность (О-Е) равняется нулю. Отрицательное значение указанной разности (О-Е) свидетельствует о потере активности по сравнению с расчетной активностью.

Однако, помимо фактического синергического действия в отношении фунгицидной активности, композиции по настоящему изобретению могут также иметь дополнительные неожиданные преимущественные свойства. Примерами таких преимущественных свойств, которые можно здесь упомянуть, являются: более эффективная способность к разложению, улучшенные токсикологические и/или экотоксикологические свойства; или улучшенные характеристики полезных растений, включая всхожесть, урожайность сельскохозяйственных культур, более развитую корневую систему, увеличение побегообразования, увеличение высоты растений, более крупная пластинка листа, меньшее увядание основных листьев, более сильные побеги, более зеленый цвет листьев, меньшая потребность в удобрениях, меньшая потребность в количестве семян, более урожайные побеги, более раннее цветение, раннее созревание зерен, меньшее "падение" растений (полегание), увеличенный рост проростков, повышенная мощность растений и раннее прорастание.

Композиции по настоящему изобретению при определенных обстоятельствах могут содержать, необязательный, дополнительный активный ингредиент в виде компонента (С), который отличается от компонента (В), где компонент (С) выбран из группы, состоящей из бензовиндифлупира, изопиразама, азоксистробина, дифенокконазола, протиоконазола, хлороталонила, фенпропицина, ацибензолар-S-метила, ципроконазола, ципродинила, фенпропиморфа, пропиконазола, гексаконазола, пенконазола, пи-

рифенокса, флудиоксонила, пироквилона, трициклазола, флуазинама, мандипропада, металаксилы, металаксилы-М, оксадиксила, оксатиапипролина, паклобутразола, серы, тиабендазола, *Aspergillus flavus* NRRL 21882 (Afla-Guard®) или *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens*, штамм FZB24 (Taegro®), при этом можно наблюдать синергическое действие между активными ингредиентами.

В вариантах осуществления настоящего изобретения, где композиции содержат компонент (А), компонент (В) и компонент (С), весовое соотношение компонента (А) с компонентом (В) и компонентом (С) может быть выбрано из значений 1:1:20, 10:1:1, 1:10:1, 1:1:10, 5:2:1, 2:1:5, 1:5:2, 5:1:1, 1:5:1, 1:1:5, 2:1:1, 1:2:1, 1:1:2 или 1:1:1.

В частности:

композиция по настоящему изобретению может содержать комбинацию фунгицидных активных ингредиентов, содержащую соединение формулы (IA) + пидифлуметофен + отдельное соединение, выбранное из компонента (С), где весовое соотношение активных ингредиентов составляет 5:2:1;

композиция по настоящему изобретению может содержать комбинацию фунгицидных активных ингредиентов, содержащую соединение формулы (IA) + пидифлуметофен + отдельное соединение, выбранное из компонента (С), где весовое соотношение активных ингредиентов составляет 2:1:5;

композиция по настоящему изобретению может содержать комбинацию фунгицидных активных ингредиентов, содержащую соединение формулы (IA) + пидифлуметофен + отдельное соединение, выбранное из компонента (С), где весовое соотношение активных ингредиентов составляет 1:5:2.

Каждая из таких композиций на основе смеси из трех активных ингредиентов может быть особенно полезна для контроля *Septoria tritici* и разновидностей ржавчины на пшенице.

Некоторые композиции по настоящему изобретению обладают системным действием и могут применяться в качестве фунгицидов для обработки листьев, почвы и семян.

С помощью композиций согласно настоящему изобретению можно подавлять или уничтожать фитопатогенные микроорганизмы, которые встречаются у растений или в частях растений (в плодах, цветках, листьях, стеблях, клубнях, корнях) разных полезных растений, в то же время части растений, которые вырастают позже, также защищены от поражения фитопатогенными микроорганизмами.

Композиции по настоящему изобретению можно применять по отношению к фитопатогенным микроорганизмам, полезным растениям, к их месту произрастания, к их материалу для размножения, продуктам, находящимся на хранении, или техническим материалам, которые находятся под угрозой поражения микроорганизмами.

Композиции по настоящему изобретению можно применять до или после заражения микроорганизмами полезных растений, их материала для размножения, продуктов, находящихся на хранении, или технических материалов.

Дополнительный аспект настоящего изобретения представляет собой способ контроля заболеваний полезных растений или их материала для размножения, вызванных фитопатогенами, который включает применение по отношению к полезным растениям, их месту произрастания или к их материалу для размножения композиции по настоящему изобретению. Предпочтительным является способ, который включает применение по отношению к полезным растениям или к их месту произрастания композиции по настоящему изобретению, более предпочтительно по отношению к полезным растениям. Дополнительно предпочтительным является способ, который включает применение по отношению к материалу для размножения полезных растений композиции по настоящему изобретению.

По всему данному документу выражение "композиция" означает различные смеси или комбинации компонентов (А) и (В), например, в отдельной форме "готовой смеси", в комбинированной смеси для опрыскивания, составленной из отдельных составов на основе компонентов в виде отдельных активных ингредиентов, такой как "баковая смесь", и в комбинированном применении отдельных активных ингредиентов в случае применения в последовательном режиме, т.е. один за другим за допустимо короткий период, такой как несколько часов или дней. Порядок применения компонентов (А) и (В) не столь важен для осуществления настоящего изобретения.

Комбинации активных ингредиентов эффективны в отношении вредных микроорганизмов, таких как микроорганизмы, которые вызывают фитопатогенные заболевания, в частности в отношении фитопатогенных грибов и бактерий.

Комбинации активных ингредиентов могут быть эффективными особенно в отношении фитопатогенных грибов, принадлежащих к следующим классам: аскомицеты (например, *Venturia*, *Podosphaera*, *Erysiphe*, *Monilinia*, *Mycosphaerella*, *Uncinula*); базидиомицеты (например, род *Hemileia*, *Rhizoctonia*, *Phakopsora*, *Puccinia*, *Ustilago*, *Tilletia*); несовершенные грибы (также известные как дейтеромицеты; например *Botrytis*, *Helminthosporium*, *Rhynchosporium*, *Fusarium*, *Septoria*, *Cercospora*, *Alternaria*, *Pyricularia* и *Pseudocercospora*); оомицеты (например *Phytophthora*, *Peronospora*, *Pseudoperonospora*, *Albugo*, *Bremia*, *Rhynchosporium*, *Pseudosclerospora*, *Plasmopara*). Предпочтительно композиции по настоящему изобретению могут быть эффективными и применяться в отношении фитопатогенных грибов, относящихся к следующим родам: *Septoria*, *Mycosphaerella*, *Pyricularia*, *Pyrenophora*, *Colletotrichum*, *Uncinula*, *Venturia*, *Ramularia*, *Erysiphe*, *Puccinia* или *Phakopsora*. В частности, из данных родов - фитопатогенные грибы *Septoria tritici*, *Mycosphaerella arachidis*, *Pyricularia oryzae*, *Pyrenophora teres*, *Colletotrichum lagenarium*, *Venturia in-*

aequalis или *Ramularia collo-cygni*.

Композиции по настоящему изобретению на основе активных ингредиентов, содержащие соединение формулы (IA), в частности композиции, содержащие пидифлуметофен в качестве компонента (B), могут быть эффективными, в частности, в отношении *Rydicularia oyuzae* или *Mycosphaerella arachidis*. В частности, композиции на основе активных ингредиентов, содержащие соединение формулы (IA) и компонент (B) в виде пидифлуметофена, могут быть эффективными, в частности, в отношении *Mycosphaerella arachidis*. Такие композиции могут характеризоваться весовым соотношением компонента (A) и компонента (B), составляющим от 10:1 до 1:10 и предпочтительно от 5:1 до 1:5.

В соответствии с настоящим изобретением "полезные растения" как правило, включают следующие виды растений: разновидности виноградной лозы; злаковые, такие как пшеница, ячмень, рожь или овес; рис; свеклу, такую как сахарная свекла или кормовая свекла; плодовые деревья, такие как семечковые, косточковые или сочные плодовые, например, разновидности яблони, разновидности груши, разновидности сливы, разновидности персика, разновидности миндаля, разновидности вишни, разновидности клубники, разновидности малины или разновидности ежевики; бобовые растения, такие как бобы, чечевица, горох или соя; масличные растения, такие как рапс, горчица, мак, разновидности оливок, подсолнечник, кокосовый орех, разновидности клещевины, какао-бобы или земляные орехи; огуречные растения, такие как кабачки, огурцы или дыни; волокнистые растения, такие как хлопчатник, лен, конопля и джут, цитрусовые, такие как апельсины, лимоны, грейпфрут или мандарины; овощи, такие как шпинат, салат-латук, спаржа, капуста, морковь, лук, томаты, картофель, разновидности тыквы или паприка; лавровые, такие как авокадо, корица или камфора; маис; табак; орехи (включая арахис); кофейное дерево; сахарный тростник; чай; вьющиеся растения; хмель; дуриан; бананы; каучоконосные растения; дерн и декоративные растения, такие как цветы (включая розы), кустарники, широколиственные деревья и вечнозеленые растения, например хвойные деревья. Данный перечень не является каким-либо ограничением, однако предпочтительно, когда полезное растение может быть выбрано из пшеницы, ячменя, риса, сои, разновидностей яблони, разновидностей винограда, огурца, разновидностей арахиса или разновидностей банана.

Термин "полезные растения" следует понимать как включающий также полезные растения, которым была придана толерантность к гербицидам, таким как бромоксинил, или классам гербицидов (таким как, например, ингибиторы HPPD, ингибиторы ALS, например, примисульфурон, просульфурон и трифлорисульфурон, ингибиторы EPSPS (5-енол-пировил-шкима-3-фосфатсинтазы), ингибиторы GS (глутаминсинтазы)) в результате осуществления традиционных способов селекции или генной инженерии. Примером сельскохозяйственной культуры, которой была придана толерантность к имидазолиномам, например имазамоксу, посредством осуществления традиционных способов селекции (мутагенез), является сурепица Clearfield® (канола). Примеры сельскохозяйственных культур, которым была придана толерантность к гербицидам или классам гербицидов с помощью методов генной инженерии, включают устойчивые к глифосату и глюфосинату сорта маиса, коммерчески доступные под торговыми названиями RoundupReady®, Herculex I® и LibertyLink®.

Термин "полезные растения" следует понимать как также включающий полезные растения, которые были трансформированы посредством применения методик с использованием рекомбинантных ДНК таким образом, что они стали способны синтезировать один или несколько токсинов избирательного действия, таких как известные, например, у токсинообразующих бактерий, в особенности бактерий рода *Bacillus*.

Токсины, которые могут быть экспрессированы такими трансгенными растениями, включают, например, инсектицидные белки, например инсектицидные белки из *Bacillus cereus* или *Bacillus popilliae*; или инсектицидные белки из *Bacillus thuringiensis*, такие как 5-эндотоксины, например CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) или Cry9C, или вегетативные инсектицидные белки (VIP), например VIP1, VIP2, VIP3 или VIP3A; или инсектицидные белки бактерий, колонизирующих нематод, например, *Photorhabdus* spp. или *Xenorhabdus* spp., таких как *Photorhabdus luminescens*, *Xenorhabdus nematophilus*; токсины, продуцируемые животными, такие как токсины скорпионов, токсины паукообразных, токсины ос и другие специфические для насекомых нейротоксины; токсины, продуцируемые грибами, такие как токсины стрептомицетов, растительные лектины, такие как лектины гороха, лектины ячменя или лектины подснежника; агглютинины; ингибиторы протеиназы, такие как ингибиторы трипсина, ингибиторы серинпротеазы, пататин, цистатин, ингибиторы папаина; белки, инактивирующие рибосому (RIP), такие как ризин, RIP кукурузы, абрин, люффин, сапорин или бриодин; ферменты метаболизма стероидов, такие как 3-гидроксистероидоксидаза, экистероид-UDP-гликозилтрансфераза, холестеролоксидаза, ингибиторы экидона, HMG-COA-редуктаза, блокаторы ионных каналов, такие как блокаторы натриевых или кальциевых каналов, эстераза ювенильного гормона, рецепторы диуретических гормонов, стильбенсинтаза, дибензилсинтаза, хитиназы и глюканазы.

В контексте настоящего изобретения под 5-эндотоксинами, например CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) или Cry9C, или вегетативными инсектицидными белками (VIP), например VIP1, VIP2, VIP3 или VIP3A, определено следует понимать также гибридные токсины, усе-

ченые токсины и модифицированные токсины. Гибридные токсины получают рекомбинантным способом с помощью новой комбинации различных доменов таких белков (см., например, WO 02/15701). Пример усеченного токсина представляет собой усеченный CryIA(b), который экспрессируется в маисе Bt11 от Syngenta Seed SAS, как описано ниже. В случае модифицированных токсинов заменены одна или несколько аминокислот токсина, встречающегося в природе. При таких аминокислотных заменах в токсин предпочтительно вводят не присутствующие в природном токсине последовательности распознавания протеазы, такие как, например, в случае CryIIIА055, катепсин-D-распознающая последовательность вставлена в токсин CryIIIА (см. WO 03/018810).

Примеры таких токсинов или трансгенных растений, способных синтезировать такие токсины, раскрыты, например, в EP-A-0374753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0427529, EP-A-451878 и WO 03/052073.

Способы получения таких трансгенных растений в целом известны специалисту в данной области и описаны, например, в публикациях, упомянутых выше.

Дезоксирибонуклеиновые кислоты CryI-типа и их получение известны, например, из WO 95/34656, EP-A-0367474, EP-A-0401979 и WO 90/13651.

Токсин, содержащийся в трансгенных растениях, придает растениям толерантность в отношении вредных насекомых. Такие насекомые могут принадлежать к любой таксономической группе насекомых, но особенно часто встречаются среди жуков (Coleoptera), двукрылых насекомых (Diptera) и бабочек (Lepidoptera).

Трансгенные растения, содержащие один или несколько генов, которые кодируют устойчивость к насекомым и экспрессируют один или несколько токсинов, являются известными, и некоторые из них коммерчески доступны. Примерами таких растений являются: YieldGard® (сорт маиса, экспрессирующий токсин CryIA(b)); YieldGard Rootworm® (сорт маиса, экспрессирующий токсин CryIIIВ(b1)); YieldGard Plus® (сорт маиса, экспрессирующий токсины CryIA(b) и CryIIIВ(b1)); Starlink® (сорт маиса, экспрессирующий токсин Cry9(c)); Herculex I® (сорт маиса, экспрессирующий токсин CryIF(a2) и фермент фосфинотрицин-N-ацетилтрансферазу (PAT) для достижения толерантности к гербициду глюфосинату аммония); NuCOTN 33В® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин CryIA(c)); Bollgard I® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин CryIA(c)); Bollgard II® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсины CryIA(c) и CryIIА(b)); VIPCOT® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин VIP); NewLeaf® (сорт картофеля, экспрессирующий токсин CryIIIА); NatureGard® и Protecta®.

Дополнительными примерами таких трансгенных сельскохозяйственных культур являются следующие.

1. Маис Bt11 от Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 Сен-Совер, Франция, регистрационный номер C/FR/96/05/10. Генетически модифицированный Zea mays, которому придали устойчивость к поражению огневкой кукурузной (*Ostrinia nubilalis* и *Sesamia nonagrioides*) при помощи трансгенной экспрессии усеченного токсина CryIA(b). Маис Bt11 также трансгенно экспрессирует фермент PAT с достижением толерантности к гербициду глюфосинату аммония.

2. Маис Bt176 от Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 Сен-Совер, Франция, регистрационный номер C/FR/96/05/10. Генетически модифицированный Zea mays, которому придали устойчивость к поражению огневкой кукурузной (*Ostrinia nubilalis* и *Sesamia nonagrioides*) при помощи трансгенной экспрессии токсина CryIA(b). Маис Bt176 также трансгенно экспрессирует фермент PAT для достижения толерантности к гербициду глюфосинату аммония.

3. Маис MIR604 от Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 Сен-Совер, Франция, регистрационный номер C/FR/96/05/10. Маис, которому была придана устойчивость к поражению насекомыми путем трансгенной экспрессии модифицированного токсина CryIIIА. Данный токсин представляет собой Cry3A055, модифицированный путем вставки последовательности распознавания катепсин-D-протеазы. Получение таких трансгенных растений маиса описано в WO 03/018810.

4. Маис MON 863 от Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Брюссель, Бельгия, регистрационный номер C/DE/02/9. MON 863 экспрессирует токсин CryIIIВ(b1) и обладает устойчивостью к определенным насекомым отряда Coleoptera.

5. Хлопчатник IPC 531 от Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Брюссель, Бельгия, регистрационный номер C/ES/96/02.

6. Маис 1507 от Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Брюссель, Бельгия, регистрационный номер C/NL/00/10. Генетически модифицированный маис для экспрессии белка Cry1F для достижения устойчивости к определенным насекомым из отряда Lepidoptera и белка PAT для достижения толерантности к гербициду глюфосинату аммония.

7. Маис NK603 x MON 810 от Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Брюссель, Бельгия, регистрационный номер C/GB/02/M3/03. Состоит из гибридных сортов маиса, выведенных традиционным способом скрещивания генетически модифицированных сортов NK603 и MON 810. Маис NK603 x MON 810 трансгенно экспрессирует белок CP4 EPSPS, полученный из штамма CP4 Agrobacterium sp., который придает толерантность к гербициду Roundup® (содержит глифосат), и также токсин

CryIA(b), полученный из *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, который обеспечивает толерантность к определенным представителям отряда Lepidoptera, в том числе к огневке кукурузной.

Трансгенные сельскохозяйственные культуры устойчивых к насекомым растений также описаны в отчете BATS за 2003 год (Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Базель, Швейцария) (<http://bats.ch>).

Термин "полезные растения" следует понимать как включающий также полезные растения, трансформированные с помощью технологий рекомбинантных ДНК таким образом, что они стали способны синтезировать антипатогенные вещества избирательного действия, такие как, например, так называемые "белки, связанные с патогенезом" (PRP, см., например, EP-A-0392225). Примеры таких антипатогенных веществ и трансгенных растений, способных синтезировать такие антипатогенные

вещества, известны, например, из EP-A-0392225, WO 95/33818 и EP-A-0353191. Способы получения таких трансгенных растений в целом известны специалисту в данной области и описаны, например, в публикациях, упомянутых выше.

Антипатогенные вещества, которые могут экспрессироваться такими трансгенными растениями, включают, например, блокаторы ионных каналов, такие как блокаторы натриевых и кальциевых каналов, например, вирусные токсины KP1, KP4 или KP6; стильбенсинтазы; дибензилсинтазы; хитиназы; глюканазы; так называемые "белки, связанные с патогенезом" (PRP; см., например, EP-A-0392225); антипатогенные вещества, продуцируемые микроорганизмами, например, пептидные антибиотики или гетероциклические антибиотики (см., например, WO 95/33818) или же белковые или полипептидные факторы, вовлеченные в защиту растений от патогенов (так называемые "гены устойчивости растений к заболеваниям", описанные в WO 03/000906).

Термин "место произрастания" полезного растения, применяемый в настоящем документе, предназначен охватывать место, на котором произрастают полезные растения, где высевают материалы для размножения растений полезных растений или где материалы для размножения растений полезных растений будут помещать в почву. Примером такого места произрастания является поле, на котором выращивают культурные растения.

Термин "материал для размножения растений" понимают как обозначающий генеративные части растения, такие как семена, которые можно применять для размножения последнего, и вегетативный материал, такой как черенки или клубни, например, картофельные. Можно упомянуть, например, семена (в строгом смысле), корни, плоды, клубни, луковицы, корневища и части растений. Также можно упомянуть проросшие растения и молодые растения, которые следует пересадить после прорастания или после появления из почвы. Эти молодые растения можно защитить до пересадки посредством полной или частичной обработки путем погружения. Предпочтительно "материал для размножения растений" следует понимать как означающий семена.

Согласно настоящему изобретению термин "природные вещества растительного происхождения, которые были отобраны из естественного жизненного цикла" обозначает растения или их части, которые были собраны из естественного жизненного цикла и которые находятся в свежесобранной форме. Примеры таких природных веществ растительного происхождения представляют собой стебли, листья, клубни, семена, плоды или зерна. Согласно настоящему изобретению термин "обработанная форма природного вещества растительного происхождения" понимают как обозначающий форму природного вещества растительного происхождения, которая является результатом процесса модификации. Такие процессы модификации можно применять для превращения природного вещества растительного происхождения в форму такого вещества, более пригодную для длительного хранения (продукты, находящиеся на хранении). Примеры таких процессов модификации представляют собой предварительное высушивание, увлажнение, дробление, измельчение, помол, прессование или обжаривание. Также подпадает под определение обработанной формы природного вещества растительного происхождения лесоматериал, либо в виде сырого лесоматериала, такого как строительный лесоматериал, опоры линий электропередач и ограждения, либо в виде готовых изделий, таких как мебель или предметы, изготовленные из древесины.

Согласно настоящему изобретению термин "природные вещества животного происхождения, которые были отобраны из естественного жизненного цикла, и/или их обработанные формы" понимают как обозначающий материал животного происхождения, такой как кожа, шкуры, выделанная кожа, меха, шерсть и т.п., и он не относится к такому материалу, когда он присутствует на живом животном. Таким образом, настоящее изобретение не распространяется на способ лечения живого животного.

Комбинации согласно настоящему изобретению могут предупреждать неблагоприятные эффекты, такие как гниение, потеря цвета или плесневение.

Комбинации по настоящему изобретению также можно применять в области защиты промышленного материала от поражения грибами. Согласно настоящему изобретению термин "промышленный материал" означает неживой материал, который был получен для применения в промышленности. Например, промышленными материалами, которые должны быть защищены от поражения грибами, могут быть клеящие вещества, шпихта, бумага, доска, ткани, ковровые покрытия, выделанная кожа, древесина, сооружения, лакокрасочные материалы, изделия из пластмассы, смазывающе-охлаждающие жидкости, водные гидравлические жидкости и другие материалы, которые могут быть заражены или разрушены

микроорганизмами. Системы охлаждения и нагрева, системы вентиляции и кондиционирования воздуха и части производственных установок, например, контуры охлаждающей воды, которые могут быть повреждены из-за размножения микроорганизмов, также можно отметить среди материалов, которые должны быть защищены. Комбинации согласно настоящему изобретению могут предупреждать неблагоприятные эффекты, такие как гниение, потеря цвета или плесневение.

Комбинации по настоящему изобретению также можно применять в области защиты технического материала от поражения грибами. Согласно настоящему изобретению термин "технический материал" включает бумагу; ковровые покрытия; сооружения; системы охлаждения и нагрева; системы вентиляции и кондиционирования воздуха и т.п. Комбинации согласно настоящему изобретению могут предупреждать неблагоприятные эффекты, такие как гниение, потеря цвета или плесневение.

В частности, комбинации согласно настоящему изобретению являются эффективными в отношении разновидностей настоящей мучнистой росы; разновидностей ржавчины; разновидностей пятнистости листьев; разновидностей бурой пятнистости и плесени; в частности, в отношении *Septoria*, *Puccinia*, *Erysiphe*, *Pyrenophora* и *Tapesia* у злаковых; *Phakopsora* у сои; *Nemileia* у кофейного дерева; *Phragmidium* у роз; *Alternaria* у разновидностей картофеля, томатов и тыквенных; *Sclerotinia* у дерна, овощей, подсолнечника и рапса; черной гнили, краснухи листьев, настоящей мучнистой росы, серой гнили и усыхания побегов у вьющегося растения; *Botrytis cinerea* у плодовых; *Monilinia* spp. у плодовых и *Penicillium* spp. у плодовых.

Комбинации согласно настоящему изобретению, кроме того, в частности, эффективны в отношении заболеваний, передающихся с семенами и передающихся через почву, которые вызваны *Alternaria* spp., *Ascochyta* spp., *Botrytis cinerea*, *Cercospora* spp., *Claviceps purpurea*, *Cochliobolus sativus*, *Colletotrichum* spp., *Epicoccum* spp., *Fusarium graminearum*, *Fusarium moniliforme*, *Fusarium oxysporum*, *Fusarium proliferatum*, *Fusarium solani*, *Fusarium subglutinans*, *Gäumannomyces graminis*, *Helminthosporium* spp., *Microdochium nivale*, *Phoma* spp., *Pyrenophora graminea*, *Pyricularia oryzae*, *Rhizoctonia solani*, *Rhizoctonia cerealis*, *Sclerotinia* spp., *Septoria* spp., *Sphacelotheca reilliana*, *Tilletia* spp., *Typhula incarnata*, *Urocystis occulta*, *Ustilago* spp. или *Verticillium* spp.; в частности, в отношении патогенов злаковых, таких как пшеница, ячмень, рожь или овес; маиса; риса; хлопчатника; сои; дерна; сахарной свеклы; рапса; разновидностей картофеля; зернобобовых культур, таких как горох, чечевица или нут; и подсолнечника.

Комбинации согласно настоящему изобретению, кроме того, особенно эффективны в отношении заболеваний, возникающих после сбора урожая, которые вызваны *Botrytis cinerea*, *Colletotrichum musae*, *Curvularia lunata*, *Fusarium semitectum*, *Geotrichum candidum*, *Monilinia fructicola*, *Monilinia fructigena*, *Monilinia laxa*, *Mucor piriformis*, *Penicillium italicum*, *Penicillium solitum*, *Penicillium digitatum* или *Penicillium expansum*, в частности в отношении патогенов плодов, таких как семечковые плоды, например, яблоки и груши, косточковые плоды, например, персики и сливы, цитрусовые, дыни, папайя, киви, манго, ягоды, например клубника, авокадо, гранат, и бананы, и орехи.

Количество, в котором будут применять комбинацию по настоящему изобретению, будет зависеть от различных факторов, таких как используемые соединения; объект обработки, как например, растения, почва или семена; тип обработки, как например, опрыскивание, опыление или протравливание семян; цель обработки, как например, профилактическая или терапевтическая; тип гриба, подлежащего контролю, или время применения.

Композиции, содержащие компонент (A) (соединение формулы (I) или (IA)) в комбинации с компонентом (B), можно применять, например, в форме отдельной "готовой смеси", в объединенной смеси для опрыскивания, составленной из отдельных составов на основе компонентов в виде отдельных активных ингредиентов, такой как "баковая смесь", и в объединенном применении отдельных активных ингредиентов в случае применения в последовательном режиме, т.е. один за другим за допустимо короткий период, такой как несколько часов или дней. Порядок применения соединения в виде компонента (A) и активного ингредиента в виде компонента (B) не столь важен для осуществления настоящего изобретения.

Некоторые из указанных композиций согласно настоящему изобретению обладают системным действием и могут применяться в качестве фунгицидов для обработки листьев, почвы и семян.

С помощью композиций согласно настоящему изобретению можно подавлять или уничтожать фитопатогенные микроорганизмы, которые встречаются у растений или в частях растений (в плодах, цветках, листьях, стеблях, клубнях, корнях) разных полезных растений, в то же время части растений, которые вырастают позже, также защищены от поражения фитопатогенными микроорганизмами.

Композиции по настоящему изобретению представляют особый интерес для контроля большого количества грибов у различных полезных растений или их семян, особенно у полевых сельскохозяйственных культур, таких как картофель, табак, и сахарная свекла, и пшеница, рожь, ячмень, овес, рис, маис, газонные травы, хлопчатник, соевые бобы, рапс, зернобобовые культуры, подсолнечник, кофейное дерево, сахарный тростник, плодовые и декоративные растения, в садоводстве и виноградарстве, у овощей, таких как разновидности огурца, бобов и тыкв.

Композиции по настоящему изобретению применяют путем обработки грибов, полезных растений, их места произрастания, их материала для размножения, природных веществ растительного и/или жи-

вотного происхождения, которые были отобраны из естественного жизненного цикла, и/или их обработанных форм или промышленных материалов, подвергающихся риску поражения грибами, комбинацией компонентов (А) и (В), предпочтительно в синергически эффективном количестве.

Композиции по настоящему изобретению можно применять до или после заражения грибами полезных растений, их материала для размножения, природных веществ растительного и/или животного происхождения, которые были отобраны из естественного жизненного цикла, и/или их обработанных форм или промышленных материалов.

Композиции согласно настоящему изобретению, в частности, применимы для контроля следующих заболеваний растений:

- вызванных видами *Alternaria* у плодовых и овощей,
- вызванных видами *Ascochyta* у зернобобовых культур,
- вызванных *Botrytis cinerea* у клубники, томатов, подсолнечника, зернобобовых культур, овощей и винограда,
- вызванных видами *Cercospora* у сои, маиса, и сахарной свеклы,
- вызванных *Cercospora arachidicola* у арахиса,
- вызванных *Cochliobolus sativus* у злаковых,
- вызванных видами *Colletotrichum* у зернобобовых культур,
- вызванных видами *Corynespora* у сои и овощей,
- вызванных видами *Erysiphe* у злаковых,
- вызванных *Erysiphe cichoracearum* и *Sphaerotheca fuliginea* у тыквенных,
- вызванных видами *Fusarium* у плодовых, овощей, злаковых и маиса,
- вызванных *Gäumannomyces graminis* у злаковых и газонных трав,
- вызванных видами *Helminthosporium* у маиса, риса и картофеля,
- вызванных *Hemileia vastatrix* на кофейном дереве,
- вызванных видами *Microdochium* у пшеницы и ржи,
- вызванных видами *Mycosphaerella* у плодовых и овощей,
- вызванных видами *Phakopsora* у сои,
- вызванных видами *Phoma* у масличных культур и кофейного дерева,
- вызванных видами *Puccinia* у злаковых, широколиственных сельскохозяйственных культур и многолетних растений,
- вызванных видами *Pseudocercospora species* у злаковых,
- вызванных *Phragmidium mucronatum* у роз,
- вызванных видами *Podosphaera* у плодовых,
- вызванных видами *Pyrenophora* у ячменя,
- вызванных *Pyricularia oryzae* у риса,
- вызванных *Ramularia collo-cygni* у ячменя,
- вызванных видами *Rhizoctonia* у хлопчатника, сои, злаковых, маиса, разновидностей картофеля, риса и газонных трав,
- вызванных *Rhynchosporium secalis* у ячменя и ржи,
- вызванных видами *Sclerotinia* у газонных трав, салата-латука, овощей, сои и рапса,
- вызванных видами *Septoria* у злаковых, сои и овощей,
- вызванных *Sphacelotheca reilliana* у маиса,
- вызванных видами *Tilletia* у злаковых,
- вызванных *Guignardia bidwellii* и *Phomopsis viticola* у вьющихся растений,
- вызванных *Urocystis occulta* у ржи,
- вызванных *Uncinula necator* у вьющихся растений,
- вызванных видами *Ustilago* у злаковых и маиса,
- вызванных видами *Venturia* у плодовых,
- вызванных *Monilia* и видами *Monilinia* у плодовых,
- вызванных видами *Penicillium species* у цитрусовых и яблонь.

Композиции по настоящему изобретению являются профилактически и/или лечебно полезными активными ингредиентами в области контроля вредителей даже при низких нормах внесения.

При применении по отношению к полезным растениям компонент (А) применяют при норме от 5 до 2000 г а.и./га, в частности от 10 до 1000 г а.и./га, например 25, 50, 75, 100 или 200 г а.и./га, совместно с от 1 до 5000 г а.и./га, в частности от 2 до 2000 г а.и./га, например 25, 50, 75, 100, 250, 500, 800, 1000, 1500 г а.и./га компонента (В).

В сельскохозяйственной практике нормы внесения композиции согласно настоящему изобретению зависят от типа необходимого эффекта и, как правило, варьируются в диапазоне от 20 до 4000 г общей комбинации на гектар.

Если композиции по настоящему изобретению применяют для обработки семян, то, как правило, достаточными являются нормы 0,001-50 г соединения формулы (I) или (IA) на кг семян, предпочтительно 0,01-10 г на кг семян и 0,001-50 г соединения в виде компонента (В) на кг семян, предпочтительно

0,01-10 г на кг семян.

Настоящее изобретение также предусматривает фунгицидные композиции, содержащие комбинацию компонентов (А) и (В), упомянутых выше, в синергически эффективном количестве вместе с приемлемым с точки зрения сельского хозяйства носителем и необязательно с поверхностно-активным веществом. В указанных композициях весовое соотношение (А) и (В) составляет, как описано в данном документе выше.

Композиции по настоящему изобретению могут быть использованы в любой традиционной форме, например, в виде сдвоенной упаковки, порошка для сухой обработки семян (DS), эмульсии для обработки семян (ES), текучего концентрата для обработки семян (FS), раствора для обработки семян (LS), диспергируемого в воде порошка для обработки семян (WS), капсульной суспензии для обработки семян (CF), геля для обработки семян (GF), концентрата эмульсии (EC), концентрата суспензии (SC), суспензии эмульсии (SE), капсульной суспензии (CS), диспергируемых в воде гранул (WG), эмульгируемых гранул (EG), эмульсии типа вода в масле (EO), эмульсии типа масло в воде (EW), микроэмульсии (ME), масляной дисперсии (OD), смешиваемого с маслом текучего состава (OF), смешиваемой с маслом жидкости (OL), растворимого концентрата (SL), суспензии сверхмалого объема (SU), жидкости сверхмалого объема (UL), технического концентрата (TK), диспергируемого концентрата (DC), смачиваемого порошка (WP) или любого технически реализуемого состава в сочетании с приемлемыми с точки зрения сельского хозяйства вспомогательными веществами.

Такие композиции могут быть получены традиционным способом, например, путем смешивания активных ингредиентов с соответствующими инертными веществами для составления (разбавителями, растворителями, наполнителями и необязательно другими ингредиентами состава, такими как поверхностно-активные вещества, биоциды, добавки, предохраняющие от замерзания, связующие вещества, загустители и соединения, которые обеспечивают вспомогательные свойства). Если необходимо длительное действие, то можно применять также традиционные составы медленного высвобождения. В частности, составы, применяемые в распыленном виде, такие как диспергируемые в воде концентраты (например, EC, SC, DC, OD, SE, EW, EO и т.п.), смачиваемые порошки и гранулы, могут содержать поверхностно-активные вещества, такие как смачивающие и диспергирующие средства и другие соединения, которые обеспечивают вспомогательные эффекты, например, продукт конденсации формальдегида с нафталинсульфонатом, алкиларилсульфонат, лигнинсульфонат, алкилсульфат жирной кислоты и этоксилированный алкилфенол, и этоксилированный жирный спирт.

Состав для протравливания семян применяют способом, известным *per se* для семян, с использованием комбинации по настоящему изобретению и разбавителя в приемлемой форме состава для протравливания семян, например, в виде водной суспензии или сухого порошка, характеризующихся хорошим прилипанием к семенам. Такие составы для протравливания семян известны из уровня техники. Составы для протравливания семян могут содержать отдельные активные ингредиенты или комбинацию активных ингредиентов в инкапсулированной форме, например, в виде капсул или микрокапсул медленного высвобождения.

Как правило, составы содержат от 0,01 до 90% по весу активного средства, от 0 до 20% приемлемого с точки зрения сельского хозяйства поверхностно-активного вещества и от 10 до 99,99% твердых или жидких инертных компонентов состава и вспомогательного(вспомогательных) вещества(веществ), при этом активное средство состоит по меньшей мере из соединения формулы I вместе с компонентом (В) и (С) и необязательно другими активными средствами, в частности микробиоцидами или консервантами или т.п. Концентрированные формы композиций, как правило, содержат от приблизительно 2 до 80%, предпочтительно от приблизительно 5 до 70% по весу активного средства. Применяемые формы состава могут, например, содержать от 0,01 до 20% по весу, предпочтительно от 0,01 до 5% по весу активного средства. Поскольку коммерческие продукты предпочтительно будут составлены в виде концентратов, то конечный потребитель обычно будет использовать разбавленные составы.

Биологические примеры

Композиции в соответствии с настоящим изобретением тестировали на биологическую (фунгицидную) активность в виде растворов в диметилсульфоксиде (DMSO) с применением одного или нескольких следующих протоколов (примеры 2-8). Стандартное описание тестов культур в жидкой среде представлено в примере 1.

Соединение в виде компонента (А), которое представляет собой (1S)-2,2-бис(4-фторфенил)-1-метилэтил-N-{{3-(ацетилокси)-4-метокси-2-пиридил}карбонил}-L-аланинат (флорилпикоксамид, с регистрационным номером по CAS 1961312-55-9), и его синтез известны из WO 2016/122802. Как уже отмечено, компонент (В) в составе композиций известен и является коммерчески доступным и/или может быть получен с применением процедур, известных из уровня техники, и/или процедур, описанных в литературе.

Пример 1. Тесты культур в жидкой среде в луночных планшетах.

Фрагменты мицелия или суспензии конидий грибов либо свежеполученные из культур гриба в жидкой среде, либо из криохранилища непосредственно смешивают с питательным бульоном. Растворы тестируемого соединения в DMSO (макс. 10 мг/мл) разбавляют с помощью 0,025% Tween 20 в 50 раз и

10 мкл данного раствора отмеряют пипеткой в планшет для микротитрования (96-луночный формат). Затем добавляют питательный бульон, содержащий споры/фрагменты мицелия гриба, с получением конечной концентрации тестируемого соединения. Тестовые планшеты инкубируют в темноте при 24°C и относительной влажности (rh), составляющей 96%. Подавление роста гриба определяют фотометрически и визуально через 3-7 суток в зависимости от патосистемы и рассчитывают процент противогрибковой активности по сравнению с необработанным контролем.

Пример 2. *Glomerella lagenarium* (син. *Colletotrichum lagenarium*, антракноз тыквенных).

Конидии гриба из криогенного хранилища непосредственно смешивали с питательным бульоном (картофельно-декстрозным бульоном PDB). После внесения DMSO-раствора тестовых композиций в планшет для микротитрования (96-луночный формат) добавляли питательный бульон, содержащий споры грибов. Тестовые планшеты инкубировали при 24°C, и подавление роста определяли фотометрически через 72 ч при 620 нм.

Пример 3. *Pyricularia oryzae* (пирикулярриоз риса).

Конидии гриба из криогенного хранилища непосредственно смешивали с питательным бульоном (картофельно-декстрозным бульоном PDB). После внесения DMSO-раствора тестовых композиций в планшет для микротитрования (96-луночный формат) добавляли питательный бульон, содержащий споры грибов. Тестовые планшеты инкубировали при 24°C и подавление роста определяли фотометрически через 72 ч.

Пример 4. *Venturia inaequalis* (парша яблони).

Конидии гриба из криогенного хранилища непосредственно смешивали с питательным бульоном (картофельно-декстрозным бульоном PDB). После внесения

DMSO-раствора тестовых композиций в планшет для микротитрования (96-луночный формат) добавляли питательный бульон, содержащий споры грибов. Тестовые планшеты инкубировали при 24°C и подавление роста определяли фотометрически через 7 суток при 620 нм.

Пример 5. *Septoria tritici* (пятнистость листьев).

Конидии гриба из криогенного хранилища непосредственно смешивали с питательным бульоном (картофельно-декстрозным бульоном PDB). После внесения DMSO-раствора тестовых композиций в планшет для микротитрования (96-луночный формат) добавляли питательный бульон, содержащий споры грибов. Тестовые планшеты инкубировали при 24°C и подавление роста определяли фотометрически через 72 ч.

Пример 6. *Mycosphaerella arachidis*, син. *Cercospora arachidicola* (бурая пятнистость арахиса).

Конидии гриба из криогенного хранилища непосредственно смешивали с питательным бульоном (картофельно-декстрозным бульоном PDB). После внесения DMSO-раствора тестовых композиций в планшет для микротитрования (96-луночный формат) добавляли питательный бульон, содержащий споры грибов. Тестовые планшеты инкубировали при 24°C и подавление роста определяли фотометрически через примерно 5-6 суток.

Пример 7. *Pyrenophora teres*.

Конидии гриба из криогенного хранилища непосредственно смешивали с питательным бульоном (картофельно-декстрозным бульоном PDB). После внесения DMSO-раствора тестовых композиций в планшет для микротитрования (96-луночный формат) добавляли питательный бульон, содержащий споры грибов. Тестовые планшеты инкубировали при 24°C и подавление роста определяли фотометрически через 72 ч.

Пример 8. *Ramularia collo-cygni*

Конидии гриба из криогенного хранилища непосредственно смешивали с питательным бульоном (картофельно-декстрозным бульоном PDB). После внесения DMSO-раствора тестовых композиций в планшет для микротитрования (96-луночный формат) добавляли питательный бульон, содержащий споры грибов. Тестовые планшеты инкубировали при 24°C и подавление роста определяли фотометрически через примерно 4 суток.

Результаты

Результаты тестов, описанных выше, продемонстрированы ниже в табл. 1-4. Эти данные демонстрируют, что наблюдается синергическая фунгицидная активность для комбинации флорилпикоксамида и другого активного ингредиента компонента (B) в отношении *Pyricularia oryzae* и *Mycosphaerella arachidis* в определенных весовых соотношениях.

Таблица 1

Фунгицидная активность композиции на основе флорилпикоксамида и бензовиндифлупира в отношении *Rugicularia oгуzae*, как описано в примере 3 выше

Флорилпикоксамид (А) (ppm)	Бензовиндифлупир (В) (ppm)	Соотношение соединения (А):(В)	Флорилпикоксамид (А), подавление (%)	Бензовиндифлупир (В), подавление (%)	Расчетная (аддитивная) активность (по Колби) (%)	Объединенное подавление (наблюдаемое) (%)
0,0031			0			
0,0063			0			
0,0125			0			
0,0250			0			
0,0500			0			
0,1000			20			
	0,0125			20		
	0,0250			50		
	0,0500			70		
	0,1000			90		
0,0031	0,0125	1:4			20	50
0,0063	0,0250	1:4			50	70
0,0125	0,0250	1:2			50	70
0,0125	0,0500	1:4			70	90
0,0250	0,0500	1:2			70	90
0,0250	0,1000	1:4			90	100
0,0500	0,0250	2:1			50	70
0,0500	0,1000	1:2			90	100
0,1000	0,0250	4:1			60	90
0,1000	0,0500	2:1			76	90

Таблица 2

Фунгицидная активность композиции на основе флорилпикоксамида и азоксистробина в отношении *Rugicularia oгуzae*, как описано в примере 3 выше

Флорилпикоксамид (А) (ppm)	азоксистробин (В) (ppm)	Соотношение соединения (А):(В)	Флорилпикоксамид (А), подавление (%)	азоксистробин (В), подавление (%)	Расчетная (аддитивная) активность (по Колби) (%)	Объединенное подавление (наблюдаемое) (%)
0,1000			20			
0,2000			50			
	0,0250			0		
	0,0500			0		
	0,1000			0		
	0,2000			0		
0,1000	0,0250	4:1			20	50
0,1000	0,0500	2:1			20	50
0,1000	0,1000	1:1			20	50
0,1000	0,2000	1:2			20	90
0,2000	0,0500	4:1			50	70
0,2000	0,1000	2:1			50	70
0,2000	0,2000	1:1			50	70

Таблица 3

Фунгицидная активность композиции на основе флорилпикоксамида и хлороталонила в отношении *Rugicularia oгуzae*, как описано в примере 3 выше

Флорилпикоксамид (А) (ppm)	хлороталонил (В) (ppm)	Соотношение соединения (А):(В)	Флорилпикоксамид (А), подавление (%)	хлороталонил (В), подавление (%)	Расчетная (аддитивная) активность (по Колби) (%)	Объединенное подавление (наблюдаемое) (%)
0,0250			0			
0,0500			20			
0,1000			30			
0,2000			60			
	0,2500			0		
	0,5000			0		
	1,0000			20		
0,0250	1,0000	1:4			20	50
0,0500	0,2500	2:1			20	50
0,0500	1,0000	1:2			36	100
0,1000	0,2500	4:1			30	60
0,1000	0,5000	2:1			30	70
0,1000	1,0000	1:1			44	100
0,2000	0,5000	4:1			60	90
0,2000	1,0000	2:1			68	100

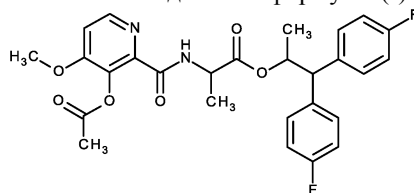
Таблица 4

Фунгицидная активность композиции на основе флорилпикоксамида и пидифлуметофена в отношении *Mycosphaerella arachidis*, как описано в примере 6 выше

Флорилпикоксамид (А) (ppm)	Пидифлуметофен (В) (ppm)	Соотношение соединения (А):(В)	Флорилпикоксамид (А), подавление (%)	Пидифлуметофен (В), подавление (%)	Расчетная (аддитивная) активность (по Колби) (%)	Объединенное подавление (наблюдаемое) (%)
0,0250			4			
0,0500			15			
0,1000			38			
	0,0025			1		
	0,0050			0		
	0,0100			28		
	0,0200			70		
0,0250	0,0050	1:2			4	63
0,0250	0,0100	1:4			31	98
0,0500	0,0050	1:1			15	58
0,0500	0,0100	1:2			39	95
0,0500	0,0200	1:4			74	100
0,1000	0,0025	4:1			38	85
0,1000	0,0050	2:1			38	75
0,1000	0,0100	1:1			55	95
0,1000	0,0200	1:2			81	99

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

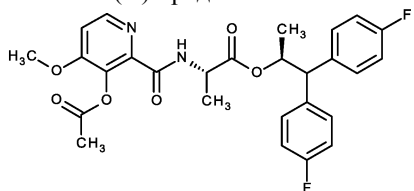
1. Фунгицидная композиция, содержащая компоненты (А) и (В) в качестве активных ингредиентов, где компонент (А) представляет собой соединение формулы (I):



(I),

или его агрохимически приемлемую соль, N-оксид, диастереоизомер, энантиомер или таутомер; и компонент (В) представляет собой пидифлуметофен, где весовое соотношение (А) и (В) составляет от 10:1 до 1:10.

2. Композиция по п.1, где компонент (А) представляет собой соединение формулы (IA):



(IA),

или его агрохимически приемлемую соль, N-оксид или таутомер.

3. Композиция по п.1 или 2, где компоненты (А) и (В) присутствуют в синергически эффективном количестве.

4. Композиция по любому из пп.1-3, где весовое соотношение (А) и (В) составляет от 5:1 до 1:5.

5. Композиция по любому из пп.1-4, дополнительно содержащая приемлемый с точки зрения сельского хозяйства носитель и/или вспомогательное вещество для составления и необязательно поверхностно-активное вещество.

6. Способ контроля заболеваний полезных растений или их материала для размножения, вызванных фитопатогенами, который включает применение по отношению к полезным растениям, их месту произрастания или их материалу для размножения композиции по любому из пп.1-5.

7. Способ по п.6, где фитопатоген выбран из рода, который представляет собой *Septoria*, *Mycosphaerella*, *Pyricularia*, *Pyrenophora*, *Colletotrichum*, *Uncinula*, *Venturia*, *Ramularia*, *Erysiphe*, *Puccinia* или *Phakospora*.

8. Способ по п.6 или 7, где фитопатоген выбран из *Septoria tritici*, *Septoria glycines*, *Septoria nodorum*, *Mycosphaerella arachidis*, *Mycosphaerella fijiensis*, *Pyricularia oryzae*, *Pyrenophora teres*, *Colletotrichum lagenarium*, *Venturia inaequalis* или *Ramularia collo-cygni* и предпочтительно *Pyricularia oryzae* или *Mycosphaerella arachidis*.

9. Способ по любому из пп.6-8, где полезное растение выбрано из злаковых, бобовых, овощей, плодовых или орехов.

10. Способ по любому из пп.6-9, где полезное растение выбрано из пшеницы, ячменя, риса, сои, разновидностей яблони, разновидностей винограда, огурца, разновидностей арахиса или разновидностей банана.

11. Применение композиции, содержащей компонент (А) и компонент (В), определенные в любом из пп.1-5, в качестве фунгицида.

