

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(11) **019491**

(13) **B1**

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ

(45) Дата публикации и выдачи патента
2014.04.30

(51) Int. Cl. *A01N 43/90* (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)

(21) Номер заявки
201100632

(22) Дата подачи заявки
2009.10.06

(54) ДИТИИНТЕТРАКАРБОКСИМИДЫ, ПРЕДНАЗНАЧЕННЫЕ ДЛЯ БОРЬБЫ С ФИТОПАТОГЕННЫМИ ГРИБАМИ, СРЕДСТВО И СПОСОБ ДЛЯ БОРЬБЫ С ФИТОПАТОГЕННЫМИ ГРИБАМИ НА ИХ ОСНОВЕ И НОВЫЕ ДИТИИНТЕТРАКАРБОКСИМИДЫ

(31) 08166621.6

(32) 2008.10.15

(33) EP

(43) 2011.10.31

(86) PCT/EP2009/007149

(87) WO 2010/043319 2010.04.22

(71)(73) Заявитель и патентовладелец:
БАЙЕР КРОПСАЙЕНС АГ (DE)

(72) Изобретатель:
**Зайтц Томас, Вахендорфф-Нойманн
Ульрике, Бентинг Йюрген, Дамен
Петер, Ферсте Арнд, Дункель Ральф,
Хиллебранд Штефан, Титъен Клаус-
Гюнтер (DE), Брунет Штефани (FR)**

(74) Представитель:
Юрчак Л.С. (KZ)

(56) US-A-3364229

ZENTZ ET AL.: "Syntheses, in vitro antibacterial and antifungal activities of a series of N-alkyl, 1,4-dithiines", FARMACO, SOCIETA CHIMICA ITALIANA, PAVIA, IT, vol. 60, no. 11-12, 1 November 2005 (2005-11-01), pages 944-947, XP005151567, ISSN: 0014-827X, cited in the application, fig. 2; tabl. 2

DRABER WILFRIED: "Synthesis of 1,4-dithi ins from maleimide derivatives", CHEMISCHE BERICHTE, 100(5), 1559-70, CODEN: CHBEAM; ISSN: 0009-2940, 1967, XP002563348, page 1

(57) Данное изобретение относится к дитиинтетракарбоксимидам, предназначенным для борьбы с фитопатогенными грибами, т.е. к применению новых и известных дитиинтетракарбоксимидов для борьбы с фитопатогенными грибами, а также к способу борьбы с фитопатогенными грибами при защите растений, а также к средствам защиты растений, которые содержат эти дитиинтетракарбоксимиды, а также к новым дитиинтетракарбоксимидам.

B1

019491

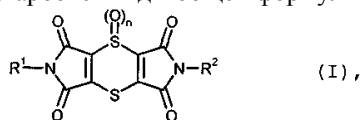
**019491
B1**

Данное изобретение относится к дитиинтетракарбоксимидам, предназначенным для борьбы с фитопатогенными грибами, т.е. к применению новых и известных дитиинтетракарбоксимидов для борьбы с фитопатогенными грибами, а также к способу борьбы с фитопатогенными грибами при защите растений, а также к средствам защиты растений, которые содержат эти дитиинтетракарбоксимиды, а также к новым дитиинтетракарбоксимидам.

Дитиинтетракарбоксимиды как таковые известны. Также известно, что эти дитиинтетракарбоксимиды могут применяться в качестве антигельминтиков против внутренних паразитов у животных, в частности, нематодов, и проявляют инсектицидное действие (см. US 3364229). Кроме того, известно, что некоторые дитиинтетракарбоксимиды обладают антибактериальным действием и оказывают заметное действие на человеческие микозы (см. Il Farmaco, 2005, 60, 944-947). Далее известно, что дитиинтетракарбоксимиды могут применяться в качестве пигмента в электрофотографических фоторецепторах или в качестве красителя в лаках и полимерах (см. JP-A 10-251265, PL-B 143804).

В связи с тем, что постоянно повышаются экологические и экономические требования к современным фунгицидам, например, в том, что касается спектра действия, токсичности, селективности, расхода количества, образования вредных остатков и удобства получения, а также, например, в связи с возможными проблемами возникновения устойчивости, существует постоянная задача по созданию новых фунгицидов, которые, как минимум, в частичных областях лучше удовлетворяют указанным требованиям.

Было найдено, что дитиинтетракарбоксимиды общей формулы (I)



в которой

R^1 и R^2 одинаковы или различны и означают водород, не замещенный или замещенный однократно или многократно фтором, хлором, бромом, радикалом $-OR^3$, радикалом $-COR^4$ (C_1-C_6)алкил, не замещенный или замещенный однократно или многократно хлором, метилом или трифторметилом (C_3-C_7)циклоалкил, в каждом случае не замещенный или замещенный однократно или многократно фтором, хлором, бромом, метилом, трифторметилом, радикалом $-COR^4$ или сульфоаминогруппой фенил или фенил-((C_1-C_4)алкил),

R^3 означает водород, метил, этил, метилкарбонил, этилкарбонил или означает не замещенный или замещенный однократно или многократно фтором, хлором, метилом, этилом, н-пропилом, изопропилом или трифторметилом фенил,

R^4 означает гидроксигруппу, метил, этил, метокси- или этоксигруппу,

n означает 0 или 1,

могут успешно применяться для борьбы с фитопатогенными грибами.

Дитиинтетракарбоксимиды формулы (I) согласно данному изобретению, а также, при необходимости, их соли очень хорошо пригодны для борьбы с патогенными для растений вредными грибами. Указанные выше соединения согласно данному изобретению проявляют прежде всего фунгицидное действие и могут применяться как при защите растений, в области домашнего хозяйства и гигиены, так и при защите материалов.

Дитиинтетракарбоксимиды, применяемые согласно данному изобретению, описываются в общем виде формулой (I). Предпочтительно применяют карбоксимиды формулы (I), в которой радикалы имеют приведенные ниже значения.

R^1 и R^2 являются предпочтительно одинаковыми или различными и предпочтительно означают водород, означают не замещенный или замещенный однократно или многократно фтором, хлором, гидрокси-, метокси-, этокси-, метилкарбонилксигруппой, карбоксилем (C_1-C_4)алкил, не замещенный или замещенный однократно или многократно хлором, метилом или трифторметилом (C_3-C_7)циклоалкил, означают в каждом случае не замещенный или замещенный от однократно до трехкратно фтором, хлором, бромом, метилом, трифторметилом, радикалом $-COR^4$, сульфоаминогруппой фенил, бензил, 1-фенэтил, 2-фенэтил или 2-метил-2-фенэтил.

R^1 и R^2 являются более предпочтительно одинаковыми или различными и более предпочтительно означают водород, метил, этил, н-пропил, изопропил, 2,2-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, в каждом случае не замещенный или замещенный хлором, метилом или трифторметилом циклопропил или циклогексил.

R^1 и R^2 наиболее предпочтительно одновременно означают метил.

R^3 предпочтительно означает водород, метил, метилкарбонил или фенил.

R^4 предпочтительно означает гидрокси- или метоксигруппу.

n предпочтительно означает 0.

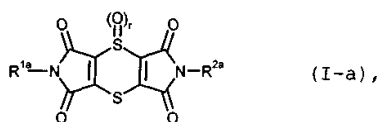
n также предпочтительно означает 1.

n более предпочтительно означает 0.

По отдельности следует назвать следующие соединения:

- (1) 2,6-диметил-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (2) 2,6-диэтил-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (3) 2,6-дипропил-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (4) 2,6-ди(пропан-2-ил)-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (5) 2,6-дидихлопропил-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (6) 2,6-бис(2,2,2-трифторэтил)-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (7) 2,6-бис[1-(трифторметил)циклопропил]-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (8) 1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (9) 2,6-бис(3,5-дихлорфенил)-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (10) 2,6-дифенил-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (11) 2,6-дибензил-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (12) 2,6-бис(2-метоксиэтил)-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (13) 2,6-бис(2-гидроксибутил)-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (14) 2,6-бис(2-гидроксипропил)-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (15) 2,6-бис(2-феноксиэтил)-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (16) 2,6-бис(2-этоксиэтил)-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (17) 2,6-бис(2-фенилпропан-2-ил)-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (18) 2,6-бис(1-фенилэтил)-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (19) 2,6-бис(2-метокси-2-метилпропил)-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (20) 2,6-ди-трет-бутил-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (21) (1,3,5,7-тетраоксо-1,3,5,7-тетрагидро-2Н,6Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-2,6-диил)диэтан-2,1-диилдиацетат;
- (22) 4,4'-(1,3,5,7-тетраоксо-1,3,5,7-тетрагидро-2Н,6Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-2,6-диил)добензолсульфонамид;
- (23) 2,2'-(1,3,5,7-тетраоксо-1,3,5,7-тетрагидро-2Н,6Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-2,6-диил)диуксусная кислота;
- (24) 2,2'-(1,3,5,7-тетраоксо-1,3,5,7-тетрагидро-2Н,6Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-2,6-диил)дипропановая кислота;
- (25) 2,2'-(1,3,5,7-тетраоксо-1,3,5,7-тетрагидро-2Н,6Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-2,6-диил)дидибутановая кислота;
- (26) 2,2'-(1,3,5,7-тетраоксо-1,3,5,7-тетрагидро-2Н,6Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-2,6-диил)дигексановая кислота;
- (27) 2,2'-(1,3,5,7-тетраоксо-1,3,5,7-тетрагидро-2Н,6Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-2,6-диил)бис(3,3-диметилбутановая кислота);
- (28) 3,3'-(1,3,5,7-тетраоксо-1,3,5,7-тетрагидро-2Н,6Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-2,6-диил)дидибутановая кислота;
- (29) 5,5'-(1,3,5,7-тетраоксо-1,3,5,7-тетрагидро-2Н,6Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-2,6-диил)дипентановая кислота;
- (30) 2,6-бис[3-(трифторметил)циклогексил]-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (31) 2,6-бис[3-(трифторметил)фенил]-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (32) 2,2'-(1,3,5,7-тетраоксо-1,3,5,7-тетрагидро-2Н,6Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-2,6-диил)бис(3-фенилпропановая кислота);
- (33) 2,6-бис(2-гидроксиэтил)-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (34) 2,6-бис(2-гидрокси-2-метилпропил)-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (35) (1,3,5,7-тетраоксо-1,3,5,7-тетрагидро-2Н,6Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-2,6-диил)дидибутан-1,2-диилдиацетат;
- (36) (1,3,5,7-тетраоксо-1,3,5,7-тетрагидро-2Н,6Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-2,6-диил)дидипропан-1,2-диилдиацетат;
- (37) 2,6-бис(гидроксиметил)-1Н,5Н-[1,4]дитиино [2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (38) 2,6-диметил-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон-4-оксид;
- (39) 2-этил-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон;
- (40) диэтил-2,2'-(1,3,5,7-тетраоксо-1,3,5,7-тетрагидро-2Н,6Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-2,6-диил)дигексаноат;
- (41) 2-[2-(1-этокси-1-оксобутан-2-ил)-1,3,5,7-тетраоксо-2,3,5,7-тетрагидро-1Н,6Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-6-ил]бутановая кислота.

Более предпочтительно применяют соединения (1), (2) и (3). Новыми являются дитиинтетракарбок-симиды формулы (I-a)



в которой

R^{1a} и R^{2a} одинаковы или различны и означают однократно или многократно замещенный фтором, радикалом $-OR^{3a}$, радикалом $-COR^{4a}$ (C_1-C_8)алкил, не замещенный или замещенный однократно или многократно галоидом, (C_1-C_4)алкилом или (C_1-C_4)галоидалкилом (C_3)циклоалкил, или означают однократно замещенный радикалом $-COR^{4a}$ в алкильной части арил-((C_1-C_4)алкил),

R^{3a} означает (C_1-C_4)алкил или означает не замещенный или замещенный однократно или многократно галоидом, (C_1-C_4)алкилом или (C_1-C_4)галоидалкилом арил,

R^{4a} означает гидроксигруппу, (C_1-C_4)алкил или (C_1-C_4)алкоксигруппу,

г означает 0 или 1,

причем, R^{1a} и R^{2a} одновременно не могут означать ацетоксиметил или метоксиметил.

R^{1a} и R^{2a} являются предпочтительно одинаковыми или различными и предпочтительно означают однократно или многократно замещенный фтором, радикалом $-OR^{3a}$, радикалом $-COR^{4a}$ (C_1-C_6)алкил, не замещенный или замещенный однократно или многократно хлором, метилом или трифторметилом (C_3)циклоалкил, или означают однократно замещенный радикалом $-COR^{4a}$ в алкильной части фенил-((C_1-C_4)-алкил).

R^{1a} и R^{2a} являются более предпочтительно одинаковыми или различными и более предпочтительно означают однократно или многократно замещенный фтором, гидрокси-, метокси-, этокси-, метилкарбонилсигруппой, карбоксилем (C_1-C_4)алкил, не замещенный или замещенный однократно или многократно хлором, метилом или трифторметилом (C_3)циклоалкил, или означают однократно замещенный радикалом $-COR^{4a}$ в алкильной части 1-фенэтил или 2-фенэтил.

R^{1a} и R^{2a} являются еще более предпочтительно одинаковыми или различными и еще более предпочтительно означают 2,2-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, в каждом случае не замещенный или замещенный хлором, метилом или трифторметилом циклопропил.

R^{3a} предпочтительно означает метил, этил или означает не замещенный или замещенный однократно или многократно фтором, хлором, метилом, этилом, n-пропилом, изопропилом или трифторметилом фенил.

R^{3a} более предпочтительно означает метил или означает фенил.

R^{4a} предпочтительно означает гидроксигруппу, метил, этил, метокси- или этоксигруппу.

R^{4a} более предпочтительно означает гидрокси- или метоксигруппу.

г предпочтительно означает 0.

г также предпочтительно означает 1.

г более предпочтительно означает 0.

В зависимости от вида приведенных выше заместителей соединения формулы (I) могут обладать кислыми или основными свойствами и могут образовывать соли с неорганическими или органическими кислотами или с основаниями, или с ионами металлов, при необходимости также внутренние соли или аддукты.

В качестве ионов металлов особенно подходят ионы элементов второй главной группы, особенно кальция и магния, третьей и четвертой главной группы, особенно алюминия, олова и свинца, а также первой - восьмой побочной группы, особенно хрома, марганца, железа, кобальта, никеля, меди, цинка и других. Особенно предпочтительны ионы металлов элементов четвертого периода. Металлы могут находиться при этом в различных присущих им валентностях.

В том случае, когда соединения формулы (I) содержат гидрокси-, карбоксигруппу или другие группы, индуцирующие кислые свойства, эти соединения могут образовывать соли с основанием.

К подходящим основаниям относятся, например, гидроксиды, карбонаты, гидрокарбонаты щелочных и щелочно-земельных металлов, в особенности натрия, калия, магния и кальция, далее аммиак, первичные, вторичные и третичные амины, содержащие (C_1-C_4)алкильные радикалы, моно-, ди- и триалканоламины, производные (C_1-C_4)алканолов, холин, а также хлорхолин. В том случае, когда соединения формулы (I) содержат амино-, алкиламиногруппу или другие группы, вызывающие основные свойства, эти соединения при взаимодействии с кислотой можно превратить в соли.

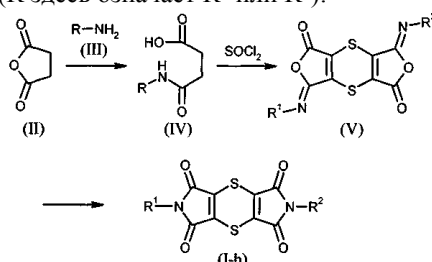
К примерам неорганических кислот относятся галоидводородные кислоты, такие как фтористо-водородная кислота, хлористо-водородная кислота, бромисто-водородная кислота и йодисто-водородная кислота, серная кислота, фосфорная кислота и азотная кислота, а также кислые соли, такие как $NaHSO_4$ и $KHSO_4$. В качестве органических кислот подходят, например, муравьиная кислота, угольная кислота и алкановые кислоты, такие как уксусная кислота, трифторуксусная кислота, трихлоруксусная кислота и пропионовая кислота, а также гликолевая кислота, тиоциановая кислота, молочная кислота, янтарная кислота, лимонная кислота, бензойная кислота, коричная кислота, щавелевая кислота, алкилсульфоновые кислоты (сульфоновые кислоты с линейными или разветвленными алкильными радикалами, содержащими 1-20 атомов углерода), арилсульфоновые или арилдисульфоновые кислоты (ароматические ради-

калы, такие как фенил или нафтил, замещенные одной или двумя сульфоновыми группами), алкилфосфоновые кислоты (фосфоновые кислоты с линейными или разветвленными алкильными радикалами, содержащими 1-20 атомов углерода), арилфосфоновые или арилдифосфоновые кислоты (ароматические радикалы, такие как фенил или нафтил, замещенные одной или двумя фосфоновыми группами), причем у алкильных, соответственно арильных радикалов могут стоять дополнительные заместители, например *p*-толуолсульфоновая кислота, салициловая кислота, *p*-аминосалициловая кислота, 2-феноксibenзойная кислота, 2-ацетоксibenзойная кислота и т.д.

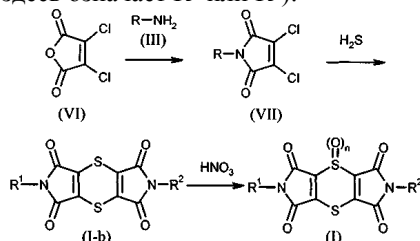
Полученные таким образом соли также проявляют фунгицидные свойства.

Применяемые согласно данному изобретению дитиинтетракарбоксимиды формулы (I) могут быть получены известными способами (см. US 3364229, Synthetic Commun. 2006, 36, 3591-3597 и II Farmaco 2005, 60, 944-947).

Например, в первом способе (см. II Farmaco 2005, 60, 944-947) на первой стадии ангидрид янтарной кислоты формулы (II) подвергают взаимодействию с амином формулы (III), при необходимости в присутствии разбавителя. Затем полученные таким образом имиды янтарной кислоты формулы (IV) подвергают взаимодействию с источником серы (например, тионилхлорид). В зависимости от условий реакции можно выделить дитииндиизоимиды формулы (V), перед тем как их переведут в дитиинтетракарбоксимиды формулы (I-b). Получение дитиинтетракарбоксимидов формулы (I) можно наглядно представить в виде следующей схемы (R здесь означает R¹ или R²):



Например, во втором способе (см. US 3364229, Synthetic Commun. 2006, 36, 3591-3597) на первой стадии ангидрид дихлормалеиновой кислоты формулы (VI) подвергают взаимодействию с амином формулы (III), при необходимости, в присутствии разбавителя. Затем полученные таким образом имиды малеиновой кислоты формулы (VII) подвергают взаимодействию с источником серы (например, тионилхлорид). Полученные таким образом дитиинтетракарбоксимиды формулы (I-b) можно, при необходимости, затем окислить. Получение дитиинтетракарбоксимидов формулы (I) можно наглядно представить в виде следующей схемы (R здесь означает R¹ или R²):



Данное изобретение относится далее к средству защиты растений для борьбы с нежелательными грибами, включающему как минимум один дитиинтетракарбоксимид формулы (I). Предпочтительно имеются в виду фунгицидные средства, которые включают используемые в сельском хозяйстве вспомогательные средства, растворители, носители, поверхностно-активные вещества или наполнители.

Наряду с этим, изобретение относится к способу борьбы с нежелательными микроорганизмами, отличающемуся тем, что на фитопатогенные грибы и/или на среду их обитания наносят согласно данному изобретению дитиинтетракарбоксимид формулы (I).

Вещество-носитель означает согласно данному изобретению природное или синтетическое, органическое или неорганическое вещество, с помощью которого можно более удобно применять биологически активные вещества, прежде всего для нанесения на растения и части растений или семенной материал, и которое смешано или связано с биологически активным веществом. Вещество-носитель, которое может быть жидким или твердым, является, как правило, инертным и должно быть применимым в сельском хозяйстве.

В качестве твердых или жидких носителей подходят, например, аммониевые соли и мука природных горных пород, таких как каолин, глинозем, тальк, мел, кварц, аттапульгит, монтмориллонит или диатомовая земля, и мука синтетических твердых пород, таких как высокодисперсная кремневая кислота, оксид алюминия и природные или синтетические силикаты, смолы, воски, твердые удобрения, вода, спирты, особенно бутанол, органические растворители, минеральные и растительные масла, а также их производные. Смеси таких носителей могут также применяться. В качестве твердых носителей для гранулятов подходят, например, измельченные и отфракционированные природные горные породы, такие

как кальцит, мрамор, пемза, сепиолит, доломит и синтетические грануляты из муки неорганического и органического происхождения, а также грануляты из органического материала, такого как древесные опилки, скорлупа кокосовых орехов, кукурузные початки и стебли табака.

В качестве сжиженных газообразных наполнителей или носителей подходят такие жидкости, которые при нормальной температуре и нормальном давлении являются газообразными, например несущие газы аэрозолей, такие как галоидуглеводороды, а также бутан, пропан, азот и двуокись углерода.

В препаратах могут применяться адгезионные средства, такие как карбоксиметилцеллюлоза, природные и синтетические порошкообразные, зернистые или в латексной форме полимеры, такие как гуммиарабик, поливиниловый спирт, поливинилацетат, а также природные фосфолипиды, такие как кефалины и лецитины, и синтетические фосфолипиды. Другими добавками могут быть минеральные и растительные масла.

В случае использования воды в качестве наполнителя можно, например, также использовать органические растворители в качестве вспомогательных средств для растворения. В качестве жидких растворителей имеют в существенной мере в виду ароматические соединения, такие как ксилол, толуол или алкил-нафталины, хлорированные ароматические углеводороды или хлорированные алифатические углеводороды, такие как хлорбензолы, хлорэтилены или дихлорметан, алифатические углеводороды, такие как циклогексан или парафины, например, фракции нефтей, минеральные и растительные масла, спирты, такие как бутанол или гликоль, а также их простые и сложные эфиры, кетоны, такие как ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон или циклогексанон, сильно полярные растворители, такие как диметилформамид и диметилсульфоксид, а также воду.

Средства согласно данному изобретению могут дополнительно содержать другие компоненты, такие как, например, поверхностно-активные вещества. В качестве поверхностно-активных веществ имеются в виду эмульгирующие и/или вспенивающие вещества, диспергирующие средства или смачивающие средства с ионными или неионными свойствами или смеси этих поверхностно-активных веществ. К их примерам относятся соли полиакриловой кислоты, соли лигносульфоновой кислоты, соли фенолсульфоновой кислоты или нафталинсульфоновой кислоты, поликонденсаты этиленоксида с жирными спиртами или с жирными кислотами, или с жирными аминами, замещенные фенолы (предпочтительно алкилфенолы или арилфенолы), соли сложных эфиров сульфоянтарной кислоты, производные таурина (предпочтительно алкилтаураты), сложные эфиры фосфорной кислоты с полиэтоксигированными спиртами или фенолами, сложные эфиры жирной кислоты с полиолами и производные соединений, содержащих сульфаты, сульфонаты и фосфаты, например, простые алкиларилполигликолевые эфиры, алкилсульфонаты, алкилсульфаты, арилсульфонаты, гидролизаты яичного белка, лигнин-сульфитовые щелоки и метилцеллюлоза. Присутствие поверхностно-активного вещества необходимо, когда одно из биологически активных веществ и/или одно из инертных веществ-носителей не растворимо в воде и когда применение осуществляется в воде. Доля поверхностно-активных веществ составляет от 5 до 40 вес.% средства согласно данному изобретению.

Могут применяться красители, такие как неорганические пигменты, например, оксид железа, оксид титана, ферроциан синий, и органические красители, такие как ализариновые, азо- и металлфталоцианиновые красители и следовые количества питательных веществ, таких как соли железа, марганца, бора, меди, кобальта, молибдена и цинка.

При необходимости могут также содержаться другие дополнительные компоненты, например, защитные коллоиды, связующие средства, клеящие вещества, загустители, тиксотропные вещества, вещества, способствующие проникновению, стабилизаторы, комплексообразующие средства, комплексанты. Как правило, биологически активные вещества можно комбинировать с любой жидкой или твердой добавкой, которую обычно используют для приготовления препаратов.

Препараты содержат, как правило, от 0,05 до 99 вес.%, от 0,01 до 98 вес.%, предпочтительно от 0,1 до 95 вес.%, более предпочтительно от 0,5 до 90 вес.% биологически активного вещества, наиболее предпочтительно от 10 до 70 вес.%.

Биологически активные вещества, соответственно средства согласно данному изобретению можно применять сами по себе или в зависимости от их физических и/или химических свойств в виде их препаратов или в виде приготовленных из них форм, готовых для применения, таких как готовые для применения аэрозоли, капсульные суспензии, концентраты для образования холодного тумана, концентраты для образования горячего тумана, грануляты в капсулах, мелкие грануляты, текучие концентраты для обработки семенного материала, готовые для применения растворы, распыляемые порошки, эмульгируемые концентраты, эмульсии масла в воде, эмульсии воды в масле, макрогрануляты, микрогрануляты, порошки, диспергируемые в масле, текучие концентраты, смешиваемые с маслом, жидкости, смешиваемые с маслом, пены, пасты, семенной материал, окруженный оболочкой из пестицидов, суспензионные концентраты, суспензионно-эмульсионные концентраты, растворимые концентраты, суспензии, порошки для опрыскивания, растворимые порошки, распыляемые средства и грануляты, растворимые в воде грануляты или таблетки, растворимые в воде порошки для обработки семенного материала, смачиваемые порошки, пропитанные биологически активным веществом природные или синтетические вещества, а также мелкие капсулы в полимерных веществах и покровные массы для семенного материала, и препа-

раты в ультрамалых объемах для образования холодного и горячего тумана.

Указанные препараты можно получить известными способами, например, в результате смешивания биологически активных веществ как минимум с одним обычным наполнителем, растворителем, соответственно разбавителем, эмульгатором, диспергирующим и/или связующим или фиксирующим средством, смачивающим средством, водоотталкивающим средством, при необходимости сиккативом и УФ-стабилизатором и, при необходимости, красящими веществами и пигментами, противовспенивателем, консервирующим средством, вторичным загустителем, клеящим веществом, гиббереллинами, а также с другими вспомогательными для переработки веществами.

Средства согласно данному изобретению охватывают не только препараты, которые уже готовы для применения и могут быть нанесены подходящей аппаратурой на растения или семенной материал, но и имеющиеся в продаже концентраты, которые перед применением необходимо разбавить водой.

Биологически активные вещества согласно данному изобретению могут применяться сами по себе, в виде их (имеющихся в продаже) препаратов или в виде приготовленных из этих препаратов форм, готовых для применения, в смеси с другими (известными) биологически активными веществами, такими как инсектициды, аттрактанты, стерилизаторы, бактерициды, акарициды, нематоциды, фунгициды, регуляторы роста растений, гербициды, удобрения, защитные вещества, соответственно полухимикаты.

Обработка согласно данному изобретению растений и частей растений биологически активными веществами, соответственно, средствами осуществляется напрямую или воздействием на их окружающее пространство, на среду обитания или на складское помещение обычными способами обработки, например окунанием, разбрызгиванием, распыскиванием, поливанием, испарением, рассыпанием, распылением, образованием тумана, рассыпанием, покрытием пеной, намазыванием, размазыванием, капельным орошением, и в случае материала для размножения, в частности, семян также сухого протравливания, мокрого протравливания, протравливания в шламе, образования налета, однослойного или многослойного покрытия и т.д. Далее существует возможность внесения биологически активных веществ способом ультрамалых объемов или инъектирования препарата биологически активного вещества или самого биологически активного вещества в почву.

Биологически активные вещества, соответственно средства согласно данному изобретению также пригодны для обработки семенного материала. Большая часть вреда, наносимого культурным растениям вредными организмами, обусловлена поражением семенного материала во время хранения или после посева, а также во время прорастания или после прорастания растения. Эта фаза является особенно критической, так как корни и ростки растущих растений особенно чувствительны и даже небольшое повреждение может привести к гибели растения. В связи с этим большой интерес состоит в том, чтобы защитить семенной материал и прорастающее растение, используя подходящее средство.

Борьба с фитопатогенными грибами путем обработки семенного материала известна в течение длительного времени и является предметом постоянных усовершенствований. Однако при обработке семенного материала возникает ряд проблем, которые не всегда могут быть удовлетворительно решены. Так следует стремиться к тому, чтобы создать способы защиты семенного материала и всходящих растений, которые позволяют избежать дополнительного нанесения средств защиты после посева или после всхода растений или его значительно снизить. Далее следует стремиться к тому, чтобы так оптимизировать количество применяемого биологически активного вещества, чтобы семенной материал и всходящее растение как можно лучше защитить от поражения фитопатогенными грибами, не повреждая, однако, при этом растение использованным биологически активным веществом. В частности, следует создать способы обработки семенного материала, которые бы вовлекали также внутренне присущие фунгицидные свойства трансгенных растений, для достижения оптимальной защиты семенного материала и всходящего растения при минимальном расходе средств защиты растений.

Изобретение также относится к применению средства согласно данному изобретению для защиты семенного материала и всходящего растения от поражения фитопатогенными грибами.

Борьбу с фитопатогенными грибами, которые поражают растения после всходов, проводят в первую очередь путем обработки средствами для защиты растений почвы и надземных частей растений. Принимая во внимание возможности влияния средств для защиты растений на окружающую среду и здоровье людей и животных, предпринимаются усилия по уменьшению количества вносимых биологически активных веществ.

Одно из преимуществ данного изобретения состоит в том, что в связи с особыми систематическими свойствами биологически активных веществ, соответственно, средств согласно данному изобретению обработка семенного материала этими биологически активными веществами, соответственно, средствами позволяет защитить от фитопатогенных грибов не только сам семенной материал, но и вырастающие из него растения после всходов.

Таким образом удастся избежать непосредственной обработки культуры к моменту посева или вскоре после него.

Также следует считать преимуществом то, что биологически активные вещества, соответственно, средства согласно данному изобретению в особенности можно применять и в трансгенном семенном материале, причем вырастающие из этого семенного материала растения способны экспримировать белок,

который действует на вредителей. Путем обработки такого семенного материала биологически активными веществами, соответственно, средствами согласно данному изобретению можно в результате экспрессии, например, инсектицидного белка бороться с определенными вредителями. Неожиданно при этом может наблюдаться дальнейший синергический эффект, который дополнительно увеличивает эффективность защиты от нападения вредителей.

Средства согласно данному изобретению пригодны для защиты семенного материала любого сорта растений, которые применяются в сельском хозяйстве, в парниках, в лесах или в садоводстве или виноградарстве. Особенно имеют в виду при этом семенной материал зерновых культур (таких как пшеница, ячмень, рожь, тритикале, просо и овес), кукурузы, хлопчатника, сои, риса, картофеля, подсолнечника, фасоли, кофе, свеклы (например, сахарная свекла и кормовая свекла), арахиса, рапса, мака, оливок, кокосовых орехов, какао, сахарного тростника, табака, овощей (таких как томаты, огурцы, лук и салат), газонной травы и декоративных растений (см. также ниже). Особенное значение придается обработке семенного материала зерновых культур (таких как пшеница, ячмень, рожь, тритикале и овес), кукурузы и риса.

Как описано ниже, обработка трансгенного семенного материала биологически активными веществами, соответственно, средствами согласно данному изобретению имеет особенное значение. Это относится к семенному материалу растений, которые содержат как минимум один гетерологический ген, создающий возможность экспрессии полипептида или белка с инсектицидными свойствами. Гетерологический ген в трансгенном семенном материале может происходить, например, из микроорганизмов видов *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* или *Gliocladium*. Предпочтительно этот гетерологический ген происходит из *Bacillus* sp., причем этот генный продукт обладает эффективностью против кукурузного мотылька (European corn borer) и/или западного кукурузного тонкопряда (Western Corn Rootworm). Более предпочтительно гетерологический ген происходит из *Bacillus thuringiensis*.

В рамках данного изобретения на семенной материал наносят средство согласно данному изобретению само по себе или в виде подходящего препарата. Семенной материал предпочтительно обрабатывают в таком состоянии, при котором он стабилен, во избежание повреждений при обработке. Вообще обработку семенного материала можно проводить в любое время в промежутке между сбором урожая и посевом. Обычно используют семенной материал, который отделен от растения и от кочанов, шелухи, стеблей, окружающей оболочки, волокна и фруктовой массы. Так, например, можно использовать семенной материал, который после уборки урожая очищен и высушен до содержания влаги менее 15 вес.%. Альтернативно можно использовать семенной материал, который после сушки, например, обработан водой и затем снова высушен.

Вообще при обработке семенного материала следует обращать внимание на то, чтобы количество средства согласно данному изобретению и/или других добавочных веществ, наносимых на семенной материал, выбиралось таким, чтобы это не повлияло на прорастание семенного материала, соответственно, не повреждались проросшие из него растения. Это особенно следует принимать во внимание в случае биологически активных веществ, которые при определенных расходных количествах могут проявлять фитотоксические эффекты.

Средства согласно данному изобретению можно наносить непосредственно, то есть в отсутствие дополнительных компонентов и без разбавления. Как правило, следует предпочесть, чтобы на семенной материал наносились средства в виде подходящего препарата. Подходящие препараты и способы обработки семенного материала известны специалистам и описаны, например, в следующих документах: US 4272417 A, US 4245432 A, US 4808430 A, US 5876739 A, US 2003/0176428 A1, WO 2002/080675 A1, WO 2002/028186 A2.

Биологически активные вещества, применяемые согласно данному изобретению, можно переводить в обычные готовые для применения препараты протравливающих средств, такие как растворы, эмульсии, суспензии, порошки, пены, пульпу или другие покровные массы для семенного материала, а также препараты в ультрамалых объемах.

Эти препараты получают известным образом, смешивая биологически активные вещества или комбинации биологически активных веществ с обычными добавками, такими, например, как обычные наполнители, а также растворители или разбавители, красители, смачивающие средства, диспергирующие средства, эмульгаторы, противовспениватели, консерванты, вторичные загустители, клеящие средства, гиббереллины, а также вода.

В качестве красителей, которые могут содержаться в препаратах протравливающих средств, применяемых согласно данному изобретению, подходят все красители, применяемые для такого рода целей. При этом можно использовать как малорастворимые в воде пигменты, так и растворимые в воде красители. В качестве примера следует назвать красители, известные под названием родамин В, С.І. пигмент красный 112 и С.І. сольвент красный 1.

В качестве смачивающих средств, которые могут содержаться в препаратах протравливающих средств, применимых согласно данному изобретению, подходят все вещества, способствующие смачиванию и обычно используемые в препаратах агрохимических биологически активных веществ. Предпочти-

тельно применяют алкилнафталинсульфонаты, такие как диизопропил- или диизобутилнафталинсульфонаты.

В качестве диспергирующих средств и/или эмульгаторов, которые могут содержаться в препаратах протравливающих средств, применяемых согласно данному изобретению, подходят все обычные для препаратов агрохимических биологически активных веществ неионные, анионные или катионные диспергирующие средства. Предпочтительно применяют неионные или анионные диспергирующие средства или смеси неионных или анионных диспергирующих средств. Подходящими неионными диспергирующими средствами являются, в частности, блок-полимеры этиленоксидпропиленоксида, простой алкилфенолполигликолевый эфир, а также простые тристирилфенолполигликолевые эфиры и их фосфатированные или сульфатированные производные. Подходящими анионными диспергирующими средствами являются, в частности, лигнинсульфонаты, соли полиакриловой кислоты и конденсаты арилсульфоната и формальдегида.

В качестве противовспенивателей, которые могут содержаться в препаратах протравливающих средств, применяемых согласно данному изобретению, подходят все пенообразующие вещества, обычно используемые в препаратах агрохимических биологически активных веществ. Предпочтительно применяют силиконовые противовспениватели и стеарат магния.

В качестве консервантов, которые могут содержаться в препаратах протравливающих средств, применимых согласно данному изобретению, подходят все вещества, используемые для такого рода целей в агрохимических средствах. В качестве примера можно привести дихлорофен и полужформаль бензилового спирта.

В качестве вторичных сгущающих средств, которые могут содержаться в препаратах протравливающих средств, применяемых согласно данному изобретению, подходят все вещества, используемые для такого рода целей в агрохимических средствах. Предпочтительно имеют в виду производные целлюлозы, производные акриловой кислоты, ксантан, модифицированные глины и высокодисперсную кремневую кислоту.

В качестве клеящих средств, которые могут содержаться в препаратах протравливающих средств, применяемых согласно данному изобретению, подходят все обычно используемые в протравливающих средствах связующие средства. Предпочтительно следует назвать поливинилпирролидон, поливинилацетат, поливиниловый спирт и тилос.

В качестве гиббереллинов, которые могут содержаться в препаратах протравливающих средств, применяемых согласно данному изобретению, предпочтительно подходят гиббереллины A1, A3 (= гиббереллиновая кислота), A4 и A7, более предпочтительно используют гиббереллиновую кислоту. Гиббереллины - являются известными соединениями (см. R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schadlingsbekämpfungsmittel", Bd. 2, Springer Verlag, 1970, p. 401-412).

Препараты протравливающих средств, применяемые согласно данному изобретению, непосредственно или после их разбавления водой могут также применяться для протравливания семенного материала разного рода, в том числе и трансгенных растений. При этом в результате взаимодействия с веществами, образовавшимися в результате экспрессии, могут также дополнительно проявиться синергические эффекты.

Для обработки семенного материала препаратами средств для протравливания семян, применяемых согласно данному изобретению, или полученными из них разбавлением водой средств, готовых для применения, подходят все обычно используемые при протравливании семян аппараты для перемешивания. В частности, при протравливании семян поступают таким образом, что семенной материал подают в смеситель, затем добавляют необходимое в каждом случае количество препарата протравливающего средства самого по себе или его раствора, полученного при предварительном разбавлении водой, и перемешивают до равномерного распределения по всему семенному материалу. При необходимости, после этого проводят сушку.

Биологически активные вещества, соответственно, средства согласно данному изобретению проявляют сильную фунгицидную эффективность и могут применяться для борьбы с нежелательными грибами при защите растений и при защите материалов.

Дитиинтетракарбоксимиды согласно данному изобретению могут применяться при защите растений для борьбы с плазмодиофоромицетами (*Plasmodiophoromyceten*), оомицетами (*Oomyceten*), хитридиомицетами (*Chytridiomyceten*), зигомицетами (*Zygomyceten*), аскомицетами (*Ascomyceten*), базидиомицетами (*Basidiomyceten*) и дейтеромицетами (*Deuteromyceten*).

Фунгицидные средства согласно данному изобретению могут использоваться для борьбы с фитопатогенными грибами в лечебных и защитных целях. В связи с этим данное изобретение относится также к лечебному и защитному способу борьбы с фитопатогенными грибами в результате использования биологически активных веществ или средств согласно данному изобретению, которые наносят на семенной материал, растения или части растений, на фрукты или на почву, на которой растения произрастают.

Средства согласно данному изобретению для борьбы с фитопатогенными грибами при защите растений содержат эффективное, но не фитотоксичное количество биологически активных веществ согласно данному изобретению. "Эффективное, но не фитотоксичное количество" означает такое количество

средства согласно данному изобретению, которое достаточно для контроля или полного уничтожения грибкового заболевания и одновременно не вызывает заметных симптомов фитотоксичности. Это расходное количество может варьироваться в широких пределах. Оно зависит от многих факторов, например, от гриба, с которым ведется борьба, от растения, от климатических условий и от компонентов, содержащихся в средстве согласно данному изобретению.

Хорошая переносимость растениями биологически активных веществ с концентрациями, необходимыми для борьбы с болезнями растений, позволяет обработку надземных частей растений, растительного и семенного материала и почвы.

Согласно данному изобретению можно обрабатывать растение целиком или части растения. Под растениями при этом понимают все растения и популяции растений, как желательные, так и нежелательные дикие или культурные растения (включая встречающиеся в природе культурные растения). Культурные растения могут быть растениями, которые получены обычными методами селекции и оптимизации или биотехнологическими и генотехнологическими методами, или комбинацией этих методов, включая трансгенные растения и включая растения, защищенные правом по защите сортов, или незащищенные сорта растений. Под частями растений следует понимать все надземные и подземные части и органы растений, такие как побег (отросток), лист, цветок и корень, причем включаются, например, листья, иголки, стебли, стволы, цветы, плоды и семена, а также корни, клубни и корневища. К частям растения относят также товарный продукт урожая, а также вегетативный и генеративный материал для размножения, например черенки, клубни, корневища, отводки и семена.

Биологически активные вещества согласно данному изобретению при хорошей переносимости растениями, хорошей переносимости теплокровными животными и хорошей переносимости окружающей средой подходят для защиты растений и органов растений, для повышения урожайности, улучшения качества продуктов урожая. Их можно предпочтительно применять в качестве средств защиты растений. Они эффективны по отношению к нормально чувствительным и устойчивым видам, а также по отношению ко всем или к отдельным стадиям развития.

В качестве растений, которые могут быть обработаны согласно данному изобретению, необходимо упомянуть следующие: хлопчатник, лен, виноград, фрукты, овощи, такие как Rosaceae sp. (например, семечковые фрукты, такие как яблоны и груши, а также косточковые фрукты, такие как абрикосы, вишни, миндаль и персики и ягоды, такие как клубника), Ribesioideae sp., Juglandaceae sp., Betulaceae sp., Anacardiaceae sp., Fagaceae sp., Moraceae sp., Oleaceae sp., Actinidaceae sp., Lauraceae sp., Musaceae sp. (например, банановые деревья и плантации), Rubiaceae sp. (например, кофе), Theaceae sp., Sterculiaceae sp., Rutaceae sp. (например, лимоны, апельсины и грейпфруты); Solanaceae sp. (например, томаты), Liliaceae sp., Asteraceae sp. (например, салат), Umbelliferae sp., Cruciferae sp., Chenopodiaceae sp., Cucurbitaceae sp. (например, огурцы), Alliaceae sp. (например, чеснок, лук), Papilionaceae sp. (например, горох); главные полезные растения, такие как Gramineae sp. (например, кукуруза, газонная трава, зерновые культуры, такие как пшеница, рожь, рис, ячмень, овес, просо и тритикале), Asteraceae sp. (например, подсолнечник), Brassicaceae sp. (например, белокочанная капуста, красная капуста, брокколи, цветная капуста, розовая капуста, китайский индау посевной, кольраби, редиска, а также рапс, горчица, хрен и клоповник), Fabaceae sp. (например, фасоль, арахис), Papilionaceae sp. (например, соя-бобы), Solanaceae sp. (например, картофель), Chenopodiaceae sp. (например, сахарная свекла, кормовая свекла, мангольд, красная свекла); полезные и декоративные растения в саду и в лесу; а также генетически модифицированные виды этих растений.

Как упомянуто выше, можно согласно данному изобретению обрабатывать все растения и их части. В одном предпочтительном варианте изобретения обрабатывают виды растений и сорта растений, встречающиеся в диком виде или полученные в результате обычных методов биологической селекции, таких как скрещивание и фузия протопластов, а также их части. В другом предпочтительном варианте изобретения обрабатывают трансгенные растения и сорта растений, которые получены методами генной технологии, при необходимости, в комбинации с обычными методами (генетически модифицированные организмы) и их части. Понятие "части", соответственно "части растений" пояснено выше. Более предпочтительно обрабатывают согласно данному изобретению растения, имеющихся в продаже или находящихся в обороте сортов растений. Под сортами растений понимают растения с новыми свойствами ("Traits"), которые получены в результате обычной селекции, в результате мутагенеза или в результате рекомбинантных ДНК-технологий. Это могут быть сорта, расы, био-и генотипы.

Способ обработки согласно данному изобретению можно использовать для обработки генетически модифицированных организмов (GMOs), например растений или семян. Генетически модифицированные растения (или трансгенные растения) представляют собой растения, у которых один гетерологический ген стабильно интегрирован в геном. Понятие "гетерологический ген" в существенной мере означает такой ген, который получен или собран вне растения и который в результате введения в геном ядра клетки, геном хлоропласта или в геном митохондрии трансформированного растения вызывает новые или улучшенные агрономические или другие свойства, экспримирует интересующий протеин или полипептид или ослабляюще регулирует или отключает другой ген, который присутствует в растении, соответственно другие гены, которые присутствуют в растении (например, с помощью антисенс-технологии,

косупрессионной или РНКи-технологии [РНКи = рибонуклеиновой кислоты интерференция]). Гетерологический ген, находящийся в геноме, также обозначают как трансген. Трансген, который характеризуется своим специфическим присутствием в геноме растения, обозначают как событие трансформации, соответственно трансгенное событие.

В зависимости от видов или сортов растений, их месторасположения и условий произрастания (почвы, климат, вегетационный период, питание) могут наблюдаться в результате обработки согласно данному изобретению также сверхаддитивные ("синергические") эффекты. Так, например, возможны следующие эффекты, которые превышают ожидаемые эффекты: уменьшение расходного количества и/или расширение спектра действия, и/или усиление эффективности применяемых согласно данному изобретению биологически активных веществ и препаратов, лучший рост растений, повышенная толерантность к высоким и низким температурам, повышенная толерантность к засухе или к содержанию солей в воде и почве, повышенная продуктивность цветения, облегчение уборки урожая, ускорение созревания, повышение размеров урожая, более крупные плоды, большая высота растений, более интенсивный зеленый цвет листьев, более раннее цветение, улучшенное качество и/или повышенная пищевая ценность продукта урожая, более высокая концентрация сахара в плодах, повышенная устойчивость при хранении и/или лучшая обрабатываемость продуктов урожая.

Комбинации биологически активных веществ при определенных расходных количествах могут также проявлять укрепляющее действие на растения. В связи с этим они подходят для мобилизации защитной системы растения для защиты от поражения нежелательными фитопатогенными грибами и/или микроорганизмами, и/или вирусами. Это может, при необходимости, быть одной из причин повышенной эффективности комбинаций согласно данному изобретению, например, по отношению к грибам. Укрепляющие устойчивость растений (индуцирующие сопротивляемость) вещества в этом контексте означают и такие вещества или комбинации веществ, которые способны так стимулировать защитную систему растения, что в случае последующего инокулирования обработанного растения нежелательными патогенными грибами наблюдается существенная (заметная) степень устойчивости по отношению к этим нежелательным фитопатогенным грибам. В связи с этим вещества согласно данному изобретению можно использовать для защиты растений от поражения упомянутыми патогенами в течение определенного промежутка времени после обработки. Промежуток времени, в течение которого достигается защитное действие, составляет, как правило, от 1 до 10 дней, предпочтительно от 1 до 7 дней после обработки растения этими биологически активными веществами.

К растениям и сортам растений, которые предпочтительно обрабатывают согласно данному изобретению, относятся все растения, которые обладают наследственностью, придающей этим растениям предпочтительные, полезные признаки (свойства) (независимо от того получены ли они в результате селекции и/или биотехнологий).

Растения и сорта растений, которые также предпочтительно могут быть обработаны согласно данному изобретению, являются устойчивыми по отношению к одному или нескольким биотическим стрессовым факторам, то есть эти растения обнаруживают улучшенную защиту от вредителей животного происхождения и микробных вредителей, таких как нематоды, насекомые, клещи, фитопатогенные грибы, бактерии, вирусы и/или вирионы.

Растения и сорта растений, которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, являются такие растения, которые устойчивы по отношению к одному или нескольким абиотическим стрессовым факторам. К абиотическим стрессовым условиям могут относиться, например, засуха, холодные и жаркие условия, осмотический стресс, застой воды, повышенное содержание соли в почве, повышенное выщелачивание минералов, озоновые условия, сильные световые условия, ограниченная доступность азотных питательных веществ, ограниченная доступность фосфорных питательных веществ или избегание тени.

Растениями и сортами растений, которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, являются такие растения, которые отличаются повышенными качествами урожая. Повышенная урожайность у этих растений может быть, например, связана с улучшенной физиологией растения, улучшенным ростом растений и улучшенным развитием растений, такими как эффективное использование воды, эффективное удержание воды, улучшенное использование азота, повышенное ассимилирование углерода, улучшенный фотосинтез, возросшая сила зародыша и ускоренное созревание. Наряду с этим урожайность можно повысить, улучшая архитектуру растений (при стрессовых и не стрессовых условиях), среди которых раннее цветение, контроль цветения для производства гибридного семенного материала, способность растений к развитию зародышей, размер растений, интернодиальное число и отстояние, рост корней, размеры семян, размеры плодов, размеры стручков, количество стручков или колосов, количество зерен в стручке или колосе, семенная масса, усиленное заполнение семян, уменьшенное выпадение семян, уменьшенное лопание стручков, а также устойчивость при хранении. К другим признакам продуктов урожая относятся состав семян, такой как содержание углеводов, содержание белка, содержание масла и состав масла, питательность, уменьшение соединений, нежелательных для питания, улучшенная перерабатываемость и улучшенная сохраняемость продуктов урожая.

Растения, которые могут быть обработаны согласно данному изобретению, представляют собой ги-

бридные растения, которые как раз экспримируют свойства гетерозиса, соответственно гибридного эффекта, что, как правило, ведет к более высокой урожайности, более высокому росту, лучшему здоровью и лучшей устойчивости по отношению к биотическим и абиотическим стрессовым факторам. Такие растения создают типичным образом в результате того, что воспитанную родительскую линию со стерильной пылью (женский партнер при скрещивании) скрещивают с другой воспитанной родительской линией с фертильной (репродуктивной) пылью (мужской партнер при скрещивании). Гибридный семенной материал получают типичным образом от растений со стерильной пылью и продают тем, кто занимается их дальнейшим размножением. Растения со стерильной пылью иногда можно получить (например, в случае кукурузы) в результате удаления метелок (то есть механического удаления мужских половых органов, соответственно, соцветий); однако более распространено, когда стерильность пыльцы связана с генетическими детерминантами в геноме растения. В этом случае, в частности, когда семена являются желательным продуктом, урожай которого хотят получить от гибридных растений, обычно полезно убедиться в том, что полностью восстановлена фертильность (репродуктивность) пыльцы в гибридных растениях, которые содержат генетические детерминанты, отвечающие за стерильность пыльцы. Этого можно добиться, используя при скрещивании таких мужских партнеров, которые содержат соответствующие гены, восстанавливающие фертильность (репродуктивность), которые обладают способностью восстановления фертильности пыльцы в гибридных растениях, содержащих генетические детерминанты, отвечающие за стерильность пыльцы. Генетические детерминанты, отвечающие за стерильность пыльцы, могут локализоваться в цитоплазме. В качестве примеров цитоплазматической стерильности пыльцы (CMS) описаны, например, виды рода брассика (*Brassica*). Генетические детерминанты стерильности пыльцы могут также локализоваться в геноме ядра клетки. Растения со стерильной пылью могут быть также получены методами биотехнологии растений, такими как генные технологии. Особенно благоприятное средство для создания растений со стерильной пылью описано в WO 89/10396, причем, например, экспримируют одну рибонуклеазу, такую как *Barnase selektiv* в *Tarpetum*-клетках в опылительных листьях. Фертильность можно также восстановить в результате экспрессии ингибитора рибонуклеазы, такого как *Varstar* в *Tarpetum*-клетках.

Растения или сорта растений (которые могут быть получены методами биотехнологии растений, такими как генные технологии), которые могут быть обработаны согласно данному изобретению, являются растениями, толерантными к гербицидам, то есть растениями, которые сделаны толерантными по отношению к одному или нескольким заданным гербицидам. Такие растения можно получить или в результате генетической трансформации, или в результате селекции растений, которая включает одну мутацию, обеспечивающую такую толерантность к гербицидам.

К толерантным к гербицидам растениям относятся, например, растения, толерантные к глифосату, то есть растения, выращенные толерантными по отношению к гербициду глифосату или к его солям. Так можно получить, например, толерантные к глифосату растения в результате трансформации растения с помощью гена, который кодирует энзим 5-энолпирувилшикимат-3-фосфатсинтазу (EPSPS). К примерам таких EPSPS-генов относятся *AgoA*-ген (мутант CT7) бактерии *Salmonella typhimurium*, CP4-ген бактерии *Agrobacterium sp.*, гены, которые кодируют один EPSPS из петунии, один EPSPS из томатов и один EPSPS из элеусина. Может иметься в виду и мутированный EPSPS. Толерантные к глифосату растения можно получить также в результате того, что экспримируют ген, который кодирует энзим глифосат-оксидоредуктазы. Толерантные к глифосату растения можно также получить в результате того, что экспримируют ген, который кодирует энзим глифосат-ацетилтрансферазы. Толерантные к глифосату растения можно также получить в результате того, что селекционируют растения, которые содержат естественно встречающиеся в природе мутации упомянутых выше генов.

К другим устойчивым к гербицидам растениям относятся, например, растения, которые выращены толерантными к гербицидам, ингибирующим энзим глутаминсинтазы, таким как биалафос, фосфинотрицин или глюфосинат. Такие растения могут быть получены в результате того, что экспримируют энзим, который обезвреживает гербицид и одного мутанта энзима глутаминсинтазы, устойчивого к ингибированию. Таким эффективным обезвреживающим энзимом является, например, энзим, который кодирует фосфинотрицин-ацетилтрансферазу (такой, как например бар- или пат-протеин, содержащийся в *Streptomyces*-видах). Растения, которые экспримируют экзогенную фосфинотрицин-ацетилтрансферазу, описаны.

К другим толерантным к гербицидам растениям относятся также растения, которые выращены толерантными к гербицидам, ингибирующим энзим гидроксифенилпируватдиоксигеназы (HPPD). В случае гидроксифенилпируватдиоксигеназы имеются в виду энзимы, которые катализируют реакцию, при которой пара-гидроксифенилпируват (HPP) превращается в гомогентисат. Растения, которые толерантны по отношению к HPPD-ингибиторам, могут быть трансформированы с помощью гена, который кодирует встречающийся в природе резистентный HPPD-энзим, или гена, который кодирует мутированный HPPD-энзим. Толерантность по отношению к HPPD-ингибиторам можно добиться также в результате того, что растения трансформируют с помощью генов, которые кодируют определенные энзимы, способствующие образованию гомогентисата, несмотря на ингибирование нативного HPPD-энзима с помощью HPPD-ингибитора. Толерантность растений по отношению к HPPD-ингибиторам можно также улучшить в ре-

зультате того, что в растениях дополнительно трансформируют ген, который кодирует энзим, толерантный к HPPD, с помощью гена, который кодирует энзим префенатдегидрогеназы.

К другим растениям, устойчивым к гербицидам, относятся растения, выращенные толерантными по отношению к ингибиторам ацетолактатсинтазы (ALS-ингибиторы). К известным ALS-ингибиторам относятся, например, сульфонилмочевина, имидазолинон, триазолопиримидин, пиримидинилокси(тио)бензоат и/или сульфонил-аминокарбонилтриазиноновые гербициды.

Известно, что различные мутации в энзиме ALS (также известном, как ацетогидроксикислоты-синтаза, AHAS) придают толерантность по отношению к различным гербицидам, соответственно, группам гербицидов. Получение растений, толерантных к сульфонилмочевине, и растений, толерантных к имидазолинону, описано в международной патентной заявке WO 1996/033270. Другие растения, толерантные к сульфонилмочевине и имидазолинону описаны также, например, в WO 2007/024782.

Другие растения, толерантные к имидазолинону и/или сульфонилмочевине, могут быть получены в результате индуцированного мутагенеза, селекции клеточных культур в присутствии гербицида или в результате мутационной селекции.

Растения или сорта растений (которые получены способами биотехнологии растений, такими как генные технологии), которые также можно обработать согласно данному изобретению, представляют собой трансгенные растения, устойчивые к насекомым, то есть растения, которые стали устойчивыми от поражения определенными целевыми насекомыми. Такие растения могут быть получены в результате генетической трансформации или в результате селекции растений, которые содержат мутацию, обеспечивающую такую устойчивость к насекомым.

Термин "устойчивое к насекомым трансгенное растение" охватывает в данном контексте любое растение, которое содержит как минимум один трансген, который включает кодирующую последовательность, кодирующую следующее:

1) инсектицидный кристаллический белок (протеин) из *Bacillus thuringiensis* или его инсектицидную часть, такие как инсектицидные кристаллические белки, описанные онлайн в http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/, или их инсектицидные части, например, белки Cry-классов белков Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Ae или Cry3Bb или их инсектицидные части; или

2) кристаллический белок из *Bacillus thuringiensis* или его часть, который в присутствии второго, другого кристаллического белка из *Bacillus thuringiensis* или его части действует инсектицидно, как бинарный токсин, который состоит из кристаллических белков Cy34 и Cy35; или

3) инсектицидный гибридный белок, который включает части двух различных инсектицидных кристаллических белков из *Bacillus thuringiensis*, такой, например, как гибридный белок из белков 1), приведенных выше, или гибридный белок из белков 2), приведенных выше, например белок Cry1A.105, который продуцируют из варианта кукурузы MON98034 (WO 2007/027777); или

4) белок согласно одному из пп.1-3, приведенных выше, в котором некоторые, в частности 1-10, аминокислоты замещены другой аминокислотой, для того чтобы добиться более высокой инсектицидной эффективности по отношению к целевым насекомым и/или для того, чтобы расширить спектр соответствующих целевых насекомых, и/или в связи с изменениями, которые были индуцированы в кодирующей ДНК во время клонирования или трансформации, такой как белок Cry3Bb1 в варианте кукурузы MON863 или MON88017 или белок Cry3A в варианте кукурузы MIR 604;

5) инсектицидный выделенный белок из *Bacillus thuringiensis* или *Bacillus cereus* или инсектицидные части его, такие как вегетативно действующие токсичные по отношению к насекомым белки (вегетативные инсектицидные белки, VIP), которые приведены по интернетовскому адресу http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.htm 1, например белки или класс белков VIP3Aa; или

6) выделенный белок из *Bacillus thuringiensis* или *Bacillus cereus*, который в присутствии другого выделенного белка из *Bacillus thuringiensis* или *B. cereus* действует инсектицидно, так же как бинарный токсин, который состоит из белков VIP1A и VIP2A;

7) инсектицидный гибридный белок, который включает части различных выделенных белков из *Bacillus thuringiensis* или *Bacillus cereus*, такой как гибридный белок 1) или гибридный белок 2), приведенных выше; или

8) белок по одному из пп.1-3, приведенных выше, в котором некоторые, в частности 1-10, аминокислоты замещены другой аминокислотой, для того чтобы достигнуть более высокой инсектицидной эффективности по отношению к целевому виду насекомых и/или для того чтобы расширить спектр соответствующих целевых видов насекомых, и/или в связи с изменениями, которые были индуцированы в кодирующей ДНК во время клонирования или трансформации (причем, кодирование сохраняется для одного инсектицидного белка), такой как белок VIP3Aa в варианте хлопчатника COT 102.

Естественно, что к устойчивым к инсектицидам трансгенным растениям в связи с данными обстоятельствами относятся также любое растение, которое включает комбинацию генов, которые кодируют белки одного из приведенных выше классов 1-8. В одном из вариантов изобретения устойчивое к инсектицидам растение содержит более одного трансгена, кодирующего белок одного из приведенных выше

классов 1-8, для того чтобы расширить спектр соответствующих целевых видов насекомых или для того, чтобы замедлить развитие устойчивости насекомых по отношению к растению, в результате того, что встраивают различные белки, которые инсектицидно действуют на целевой вид насекомого, однако имеют отличный характер действия, такой как присоединение к различным местам присоединения рецептора у насекомого.

Растения или сорта растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, такими как генные технологии), которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, являются толерантными по отношению к абиотическим стрессовым факторам. Такие растения могут быть получены в результате генетической трансформации или в результате селекции растений, которые содержат одну мутацию, создающую устойчивость к стрессу. К особенно полезным растениям с толерантностью по отношению к стрессам относятся следующие:

а) растения, которые содержат трансген, способный понижать экспрессию и/или активность гена, отвечающего за поли(ADP-рибоза)полимеразу (PARP) в растительных клетках или в растениях;

б) растения, которые содержат трансген, создающий толерантность к стрессам, который способен понижать экспрессию и/или активность гена, отвечающего за кодирование PARC в растениях или в растительных клетках;

в) растения, которые содержат трансген, создающий толерантность к стрессам, который кодирует функциональный для растений энзим пути биосинтеза никотинамидадениндинуклеотид-сальваже, среди них никотинамидазу, никотинатфосфоррибосилтрансферазу, никотиновой кислоты мононуклеотидаденилтрансферазу, никотинамидадениндинуклеотидсинтеазу или никотинамид-фосфоррибосилтрансферазу.

Растения или сорта растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, такими как генные технологии), которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, отличаются измененным количеством, качеством и/или лучшей сохраняемостью при хранении продукта урожая и/или измененными свойствами определенных компонентов продукта урожая, например:

1) трансгенные растения, которые синтезируют модифицированный крахмал, отличающийся измененными физико-химическими свойствами, в частности содержанием амилозы или соотношением амилоза/амилопектин, степенью разветвления, средней длиной цепи, разделением боковых цепей, поведением вязкости, прочностью геля, размерами зерен крахмала и/или морфологией зерен крахмала по сравнению с крахмалом, который синтезирован дикими типами клеток растений или растений, так что этот модифицированный крахмал лучше подходит для некоторых применений;

2) трансгенные растения, которые синтезируют некрахмальные углеводные полимеры, или некрахмальные углеводные полимеры, свойства которых по сравнению с дикими типами растений изменены без генетических модификаций; к примерам относятся растения, которые продуцируют полифруктозу, предпочтительно типа инулина и левана, растения, которые продуцируют альфа-1,4-глюкан, растения, которые продуцируют альфа-1,6-разветвленные альфа-1,4-глюканы и растения, которые продуцируют альтернан;

3) трансгенные растения, которые продуцируют гиалуронан.

Растения или сорта растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, такими как генные технологии), которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, представляют собой растения хлопчатника с измененными свойствами волокон. Такие растения могут быть получены в результате генетической трансформации или в результате селекции растений, которые содержат одну мутацию, которая вызывает такие изменения свойств волокон; к ним относятся:

а) растения, такие как растения хлопчатника, которые содержат измененную форму генов целлюлозасинтазы;

б) растения, такие как растения хлопчатника, которые содержат измененную форму gsw2- или gsw3-гомологов нуклеиновых кислот;

в) растения, такие как растения хлопчатника, с повышенной экспрессией сахарозефосфатсинтазы;

д) растения, такие как растения хлопчатника, с повышенной экспрессией сахарозесинтазы;

е) растения, такие как растения хлопчатника, у которых изменен момент времени пропускания плазмодесмов у основания клетки волокна, например, в результате регулирования вниз волоконселективной β -1,3-глюканазы;

ф) растения, такие как растения хлопчатника с волокнами с измененной реакционной способностью, например, в результате экспрессии гена N-ацетилглюкозамин-трансферазы, среди них также podC, и гена хитинсинтазы.

Растения или сорта растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, такими как генные технологии), которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, представляют собой такие растения, как рапс или родственные Brassica-растения с измененными свойствами по составу масла. Такие растения могут быть получены в результате генетической трансформации или в результате селекции растений, которые содержат одну мутацию, которая вызывает такие изменения свойств масла; к ним относятся:

а) растения, такие как растения рапса, которые продуцируют масло с высоким содержанием олеи-

новой кислоты;

b) растения, такие как растения рапса, которые продуцируют масло с низким содержанием линолевой кислоты;

c) растения, такие как растения рапса, которые продуцируют масло с низким содержанием насыщенных жирных кислот.

Особенно полезными трансгенными растениями, которые могут быть обработаны согласно данному изобретению, являются растения, с одним или несколькими генами, кодирующими один или несколько токсинов, трансгенные растения, которые продаются под торговыми названиями: YIELD GARD® (например, кукуруза, хлопчатник, соя-бобы), KnockOut® (например, кукуруза), BiteGard® (например, кукуруза), BT-Xtra® (например, кукуруза), StarLink® (например, кукуруза), Bollgard® (хлопчатник), Nucleon® (хлопчатник), Nucleon 33B® (хлопчатник), NatureGard® (например, кукуруза), Protecta® и NewLeaf® (картофель). Толерантными к гербицидам растениями, которые следует упомянуть, являются, например, сорта кукурузы, сорта хлопчатника и сорта соя-бобов, которые продаются под следующими торговыми названиями: Roundup Ready® (толерантность к глифосату, например, кукуруза, хлопчатник, соя-бобы), Liberty Link® (толерантность к фосфинотрицину, например, рапс), IMI® (толерантность к имидазолинону) и SCS® (толерантность к сульфонилмочевине, например, кукуруза). К устойчивым к гербицидам растениям (растения, традиционно воспитанные на толерантности к гербицидам), которые следует упомянуть, относятся сорта, продаваемые под торговым названием Clearfield® (например, кукуруза).

Особенно полезными трансгенными растениями, которые могут быть обработаны согласно данному изобретению, являются растения, в которых произошли события трансформации или комбинация событий трансформации и которые, например, приведены в базе данных различных национальных или региональных ведомств (см., например, http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx и <http://www.agbios.com/dbase.php>).

Биологически активные вещества, соответственно средства согласно данному изобретению можно также применять при защите материалов для защиты технических материалов от поражения и разрушения нежелательными микроорганизмами, такими как, например, грибы.

Под техническими материалами следует понимать в данной связи неживые материалы, которые приготовлены для применения в технике. Например, техническими материалами, которые должны быть защищены от изменения или разрушения под воздействием грибов, могут быть клеящие вещества, клеи, бумага и картон, текстиль, кожа, древесина, лакокрасочные материалы и изделия из пластмасс, смазочно-охлаждающие средства и другие материалы, которые могут подвергаться поражению микроорганизмами или разрушаться ими. Среди защищаемых материалов следует назвать также части производственных установок, например контуры водяного охлаждения, охлаждающие и нагревающие системы, проветривающие и кондиционирующие установки, которым может быть причинен ущерб за счет размножения микроорганизмов. В рамках данного изобретения следует назвать в качестве технических материалов предпочтительно клеящие вещества, клеи, бумагу и картон, кожу, древесину, лакокрасочные материалы, смазочно-охлаждающие средства и жидкости-теплоносители, особенно предпочтительно древесину. Биологически активные вещества, соответственно средства согласно данному изобретению могут предотвратить нежелательные эффекты, такие как гниение (истлевание), распад, окрашивание, обесцвечивание или заплесневение. Наряду с этим, соединения согласно данному изобретению можно применять для защиты от обрастания предметов, в частности, корабельных корпусов, сит, сетей, сооружений, причалов и сигнальных установок, которые соприкасаются с морской водой или со сточными водами.

Способ борьбы с нежелательными грибами согласно данному изобретению можно также применять для защиты товаров, подлежащих длительному хранению (Storage Goods). Под "товарами, подлежащими длительному хранению," при этом понимают природные вещества растительного или животного происхождения, или продукты их переработки, которые получены из природы и для которых необходима долговременная защита. Товары, подлежащие длительному хранению, растительного происхождения, такие как, например, растения или части растений, например, стебли, листья, клубни, семена, фрукты, зерна, могут быть защищены в виде свежесобранного урожая или после переработки с (предварительной) сушкой, увлажнением, измельчением, перемалыванием, прессованием или поджариванием. Товары, подлежащие длительному хранению, охватывают также полезную древесину, является ли она не переработанной, такой как строительный лес, матчи линий электроснабжения и ограды, или в виде готовых изделий, таких как мебель. К товарам, подлежащим длительному хранению, животного происхождения относятся, например, шкуры животных, кожа, шубы и волосы. Биологически активные вещества согласно данному изобретению могут предотвращать такие отрицательные эффекты, как гниение, разрушение, окрашивание, обесцвечивание или заплесневение.

В качестве примера, но ни в коем случае не ограничивая, следует назвать некоторых возбудителей грибковых, которые могут быть обработаны согласно данному изобретению:

заболевания, вызываемые возбудителями истинной мучнистой росы, такими как, например, виды рода блумерия (*Blumeria*), например *Blumeria graminis*; виды рода подосфера (*Podospaera*), такие как, например, *Podospaera leucotricha*; виды рода сферотека (*Sphaerotheca*), такие как, например, *Sphaerotheca fuliginea*; виды рода унцинула (*Uncinula*), такие как, например, *Uncinula necator*;

заболевания, вызываемые возбудителями болезней ржавления, такими как, например, виды рода гимноспорангиум (*Gymnosporangium*), такие как, например, *Gymnosporangium sabinae*; виды рода гемилея (*Hemileia*), такие как, например, *Hemileia vastatrix*; виды рода факопсора (*Phakopsora*), такие как, например, *Phakopsora pachyrhizi* и *Phakopsora meibomia*; виды рода пукциния (*Puccinia*), такие как, например, *Puccinia recondita* или *Puccinia triticina*; виды рода уромисец (*Uromyces*), такие как, например, *Uromyces appendiculatus*;

заболевания, вызываемые возбудителями из группы оомицетов (*Oomyceten*), такими как, например, виды рода бремия (*Bremia*), такие как, например, *Bremia lactucae*; виды рода пероноспора (*Peronospora*), такие как, например, *Peronospora pisi* или *P. brassicae*; виды рода фитофтора (*Phytophthora*), такие как, например, *Phytophthora infestans*; виды рода плазмопара (*Plasmopara*), такие как, например, *Plasmopara viticla*; виды рода псевдопероноспора (*Pseudoperonospora*), такие как, например, *Pseudoperonospora humuli* или *Pseudoperonospora cubensis*; виды рода питиум (*Pythium*), такие как, например, *Pythium ultimum*;

заболевания, приводящие к образованию пятен на листьях и увяданию листьев, которые вызывают, например, виды рода алтернария (*Alternaria*), такие как, например, *Alternaria solani*; виды рода церкоспора (*Cercospora*), такие как, например, *Cercospora beticola*; виды рода кладоспориум (*Cladosporium*), такие как, например, *Cladosporium cucumerinum*; виды рода кохлиоболус (*Cochliobolus*), такие как, например, *Cochliobolus sativus* (конидиевая форма: Дрекслера, син: гельминтоспориум); виды рода коллетотрихум (*Colletotrichum*), такие как, например, *Colletotrichum lindemuthianum*; виды рода циклоконииум (*Cycloconium*), такие как, например, *Cycloconium oleaginum*; виды рода диапорте (*Diaporthe*), такие как, например, *Diaporthe citri*; виды рода элсиное (*Elsinoe*), такие как, например, *Elsinoe fawcettii*; виды рода глоеоспориум (*Gloeosporium*), такие как, например, *Gloeosporium laeticolor*; виды рода гломерелла (*Glomerella*), такие как, например, *Glomerella singulata*; виды рода гуигнардия (*Guignardia*), такие как, например, *Guignardia bidwellii*; виды рода лептосферия (*Leptosphaeria*), такие как, например, *Leptosphaeria maculans*; виды рода магнапорте (*Magnaporthe*), такие как, например, *Magnaporthe grisea*; виды рода микродохииум (*Microdochium*), такие как, например, *Microdochium nivale*; виды рода микосферелла (*Mycosphaerella*), такие как, например, *Mycosphaerella graminicola* и *M. fijiensis*; виды рода феосферия (*Phaeosphaeria*), такие как, например, *Phaeosphaeria nodorum*; виды рода пиренофора (*Pyrenophora*), такие как, например, *Pyrenophora teres*; виды рода рамулария (*Ramularia*), такие как, например, *Ramularia collo-cygni*; виды рода ринхоспориум (*Rhynchosporium*), такие как, например, *Rhynchosporium secalis*; виды рода септория (*Septoria*), такие как, например, *Septoria arii*; виды рода тифула (*Typhula*), такие как, например, *Typhula incarnata*; виды рода вентурия (*Venturia*), такие как, например, *Venturia inaequalis*;

заболевания корней и стеблей, которые вызывают, например, виды рода кортициум (*Corticium*), такие как, например, *Corticium graminearum*; виды рода фузариум (*Fusarium*), такие как, например, *Fusarium oxysporum*; виды рода гаеуманномицес (*Gaeumannomyces*), такие как, например, *Gaeumannomyces graminis*; виды рода ризоктония (*Rhizoctonia*), такие как, например, *Rhizoctonia solani*; виды рода тапезия (*Tapesia*), такие как, например, *Tapesia acuformis*; виды рода тиелавиопсис (*Thielaviopsis*), такие как, например, *Thielaviopsis basicola*;

заболевания колосьев и метелок (включая кочаны кукурузы), которые вызывают, например, виды рода алтернария (*Alternaria*), такие как, например, *Alternaria* spp.; виды рода аспергиллус (*Aspergillus*), такие как, например, *Aspergillus flavus*; виды рода кладоспориум (*Cladosporium*), такие как, например, *Cladosporium cladosporioides*; виды рода клавицепс (*Claviceps*), такие как, например, *Claviceps purpurea*; виды рода фузариум (*Fusarium*), такие как, например, *Fusarium culmorum*; виды рода гибберелла (*Gibberella*), такие как, например, *Gibberella zeae*; виды рода монографелла (*Monographella*), такие как, например, *Monographella nivalis*; виды рода септория (*Septoria*), такие как, например, *Septoria nodorum*;

заболевания, вызываемые головневыми грибами, такими как, например, виды рода сфациелотека (*Sphaelotheca*), такие как, например, *Sphaelotheca reiliana*; виды рода тиллетия (*Tilletia*), такие как, например, *Tilletia caries*, *T. controversa*; виды рода уроцистис (*Urocystis*), такие как, например, *Urocystis oculta*; виды рода устилаго (*Ustilago*), такие как, например, *Ustilago nuda*, *U. nuda tritici*;

гниение фруктов, которое вызывают, например, виды рода аспергиллус (*Aspergillus*), такие как, например, *Aspergillus flavus*; виды рода ботритис (*Botrytis*), такие как, например, *Botrytis cinerea*; виды рода пенициллиум (*Penicillium*), такие как, например, *Penicillium expansum* и *P. purpurogenum*; виды рода склеротиния (*Sclerotinia*), такие как, например, *Sclerotinia sclerotiorum*; виды рода вертицилий (*Verticillium*), такие как, например, *Verticillium albo-atrum*; происходящие от семян и почвы гнили и увядания, а также заболевания сеянцев, которые вызывают, например, виды рода фузариум (*Fusarium*), такие как, например, *Fusarium culmorum*; виды рода фитофтора (*Phytophthora*), такие как, например, *Phytophthora sacorum*; виды рода питиум (*Pythium*), такие как, например, *Pythium ultimum*; виды рода ризоктония (*Rhizoctonia*), такие как, например, *Rhizoctonia solani*; виды рода склеротиум (*Sclerotium*), такие как, например, *Sclerotium rolfsii*;

раковые заболевания, галлы (наросты) и ведьмины метелки, которые вызывают, например, виды рода нектрия (*Nectria*), такие как, например, *Nectria galligena*;

заболевания увядания, которые вызывают, например, виды рода монилина (*Monilinia*), такие как, например, *Monilinia laxa*;

деформации листьев, соцветий и фруктов, которые вызывают, например, виды рода тафрина (*Taphrina*), такие как, например, *Taphrina deformans*;

дегенерационные заболевания древесных растений, которые вызывают, например, виды рода эска (*Esca*), такие как, например, *Phaemoniella clamydospora*, *Phaeoacremonium aleophilum* и *Fomitiporia mediterranea*;

заболевания цветов и семян, которые вызывают, например, виды рода ботритис (*Botrytis*), такие как, например, *Botrytis cinerea*;

заболевания клубней растений, которые вызывают, например, виды рода ризоктония (*Rhizoctonia*), такие как, например, *Rhizoctonia solani*; виды рода гельминтоспориум (*Helminthosporium*), такие как, например, *Helminthosporium solani*;

заболевания, которые вызывают бактериальные возбудители, например, виды рода ксантомонас (*Xanthomonas*), такие как, например, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*; виды рода псевдомонас (*Pseudomonas*), такие как, например, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*; виды рода эрвиния (*Erwinia*), такие как, например, *Erwinia amylovora*.

Предпочтительно можно бороться со следующими болезнями соя-бобов:

грибковые заболевания листьев, стеблей, стручков и семян, которые вызывают, например, пятна на листьях, вызываемые видом рода алтернария (*Alternaria spec. atrans tenuissima*), антракнозе (*Anthraco*) (*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*), коричневые пятна (*Septoria glycines*), пятна на листьях и увядание листьев, вызываемые видом рода церкоспора (*Cercospora kikuchii*), увядание листьев, вызываемые видом рода хоанефора (*Choanephora infundibulifera trispora* (син.)), пятна на листьях, вызываемые видом рода дактилиофора (*Dactuliophora glycines*), пушистая плесень, вызываемые видом рода пероноспора (*Peronospora manshurica*), увядание, вызываемое видом рода дрекслера (*Drechslera glycini*), ленточные пятна на листьях, вызываемые видом рода церкоспора (*Cercospora sojae*), пятна на листьях, вызываемые видом рода лептосферулина (*Leptosphaerulina trifolii*), пятна на листьях, вызываемые видом рода филлостикта (*Phyllosticta sojaecola*), увядание стручков и стеблей, вызываемое видом рода фомопсис (*Phomopsis sojae*), пылевидная мучнистая роса, вызываемая видом рода микросфера (*Microsphaera diffusa*), пятна на листьях, вызываемые видом рода пиренохаета (*Purenochaeta glycines*), увядание надземных частей, листья и тканей растений, вызываемое видом рода ризоктония (*Rhizoctonia solani*), ржа, головня, вызываемые видами рода факопсора (*Phakopsora pachyrhizi*, *Phakopsora meibomia*), коркообразные пятна, вызываемые видом рода сфацелома (*Sphaeloma glycines*), увядание листьев, вызываемое видом рода стемфилиум (*Stemphylium botryosum*), точечные пятна, вызываемые видом рода коринеспора (*Corynespora cassicola*).

Грибковые заболевания на корнях и стеблях, которые вызывают, например, черное гниение корней, вызываемые видом рода калонектрия (*Calonectria crotalariae*), углевидное гниение, вызываемые видом рода макрофомина (*Macrophomina phaseolina*), увядание или поникание, гниение корней и кроны и стручков, вызываемое видами рода фузариум (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium orthoceras*, *Fusarium semitectum*, *Fusarium equiseti*), гниение корней, вызываемое видами родов миколептодискус (*Mycolopodiscus terrestris*), неокосмоспора (*Neocosmospora vasinfecta*), увядание кроны и стеблей, вызываемые видом рода диапорте (*Diaporthe phaseolorum*), язва стеблей, вызываемые видом рода диапорте (*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*), гниение, вызываемое видом рода фитопфтора (*Phytophthora megasperma*), коричневое гниение стеблей (*Phialophora gregata*), гниение, вызываемое видами рода питиум (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium irregulare*, *Pythium debaryanum*, *Pythium myriotylum*, *Pythium ultimum*), гниение корней, разрушение стеблей и гибель от милдью, вызываемое видом рода ризоктония (*Rhizoctonia solani*), разрушение стеблей, вызываемое видом рода склеротиния (*Sclerotinia sclerotiorum*), южное увядание, вызываемое видом рода склеротиния (*Sclerotinia rolfsii*), гниение корней, вызываемое видом рода тиелавиопсис (*Thielaviopsis basicola*).

В качестве микроорганизмов, которые могут вызвать деструкцию или изменение технических материалов, следует назвать грибы. Преимущественно биологически активные вещества согласно данному изобретению действуют на грибы, особенно плесневые грибы, окрашивающие древесину и разрушающие древесину грибы (базидиомицеты). Следует назвать в качестве примера грибы следующих родов: альтернария (*Alternaria*), таких видов как *Alternaria tenuis*; аспергиллус (*Aspergillus*), таких видов как *Aspergillus niger*; хетомииум (*Chaetomium*), таких видов как *Chaetomium globosum*; кониофора (*Coniophora*), таких видов как *Coniophora puetana*; лентинус (*Lentinus*), таких видов как *Lentinus tigrinus*; пенициллиум (*Penicillium*), таких видов как *Penicillium glaucum*; полипорус (*Polyporus*), таких видов как *Polyporus versicolor*; ауреобазидиум (*Aureobasidium*), таких видов как *Aureobasidium pullulans*; склерофома (*Sclerophoma*), таких видов как *Sclerophoma pityophila*; триходерма (*Trichoderma*), таких видов как *Trichoderma viride*.

Кроме того, биологически активные вещества согласно данному изобретению проявляют очень хорошее антимикотическое действие. Они обладают очень широким антимикотическим спектром действия, в частности, по отношению к дерматофитам и побеговым грибам, плесневым и дифазным грибам (например, по отношению к видам рода кандиды (*Candida*), таким как *Candida albicans*, *Candida glabrata*), а также к *Epidermophyton floccosum*, видам рода аспергиллус (*Aspergillus*), таким как *Aspergillus niger* и

Aspergillus fumigatus, видам рода трихофитон (*Trichophyton*), таким как *Trichophyton mentagrophytes*, видам рода микроспорой (*Microsporon*), таким как *Microsporon canis* и *audouinii*. Перечисление этих грибов ни в коем случае не ограничивает охватываемый микотический спектр, а только носит пояснительный характер.

При применении биологически активных веществ согласно данному изобретению в качестве фунгицидов расходное количество в зависимости от типа применения может варьироваться в широком интервале. Расходное количество биологически активных веществ согласно данному изобретению составляет при обработке частей растений, например листьев, от 0,1 до 10000 г/га, предпочтительно от 10 до 1000 г/га, более предпочтительно от 50 до 300 г/га (при применении поливнием или капанием можно даже уменьшить расходное количество особенно в том случае, когда используют инертные субстраты, такие как каменная вата или перлит); при обработке семенного материала от 2 до 200 г на 100 кг семенного материала, предпочтительно от 3 до 150 г на 100 кг семенного материала, более предпочтительно от 2,5 до 25 г на 100 кг семенного материала, наиболее предпочтительно от 2,5 до 12,5 г на 100 кг семенного материала; при обработке почвы от 0,1 до 10000 г/га, предпочтительно от 1 до 5000 г/га.

Эти расходные количества приведены в качестве примера, но ни в коем случае не являются ограничивающими по смыслу изобретения.

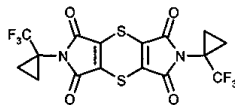
Биологически активные вещества, соответственно средства согласно данному изобретению таким образом можно использовать для того, чтобы защитить растения в течение определенного промежутка времени после обработки от нападения перечисленных возбудителей вреда. Промежуток времени, в течение которого достигается эта защита, простирается, как правило, на 1-28 дней, предпочтительно на 1-14 дней, еще более предпочтительно на 1-10 дней, наиболее на 1-7 дней после обработки растений биологически активными веществами, соответственно до 200 дней после обработки семенного материала.

Кроме того, в результате обработки согласно данному изобретению можно уменьшить содержание микотоксинов в продуктах урожая и полученных из них продуктах питания и кормах. В особенности, но не исключительно здесь следует назвать следующие микотоксины: деоксиниваленол (DON), ниваленол, 15-Ас-DON, 3-Ас-DON, Т2- и НТ2-токсин, фумонисин, зеараленон, монилиформин, фузарин, диацеотоксискирпенол (DAS), беауверин, энниатин, фузаропротрофин, фузаренол, охратоксин, патулин, алкалоиды спорыньи и афлатоксины, которые могут быть вызваны, например, следующими грибами: *Fusarium spec*, такими как *Fusarium acuminatum*, *F. avenaceum*, *F. crookwellense*, *F. culmorum*, *F. graminearum* (*Gibberella zeae*), *F. equiseti*, *F. fujikoroii*, *F. musarum*, *F. oxysporum*, *F. proliferatum*, *F. poae*, *F. pseudograminearum*, *F. sambucinum*, *F. scirpi*, *F. semitectum*, *F. solani*, *F. sporotrichoides*, *F. langsethiae*, *F. subglutinans*, *F. tricinctum*, *F. verticillioides* и др., а также такими, как *Aspergillus spec.*, *Penicillium spec.*, *Claviceps purpurea*, *Stachybotrys spec.* и др.

Приведенные растения могут быть особенно предпочтительно обработаны согласно данному изобретению соединениями общей формулы (I) средств согласно данному изобретению. Приведенные выше предпочтительные области биологически активных веществ, соответственно, средств справедливы также для обработки этих растений. Наиболее предпочтительна обработка растений приведенными в этом тексте наиболее предпочтительными соединениями, соответственно, средствами.

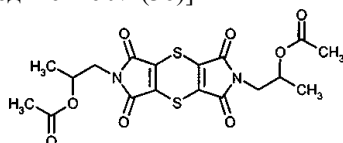
Примеры получения

Получение 2,6-бис[1-(трифторметил)циклопропил]-1Н,5Н-[1,4]-дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон [соединение № (7)]



К раствору 0,8 г (3,55 ммоль) 4-оксо-4-[[1-(трифторметил)циклопропил]амино}бутановой кислоты (IV-1) в 2 мл диоксана добавляют при охлаждении льдом (15°C) медленно по каплям 7,57 мл (103,75 ммоль) тионилхлорида. Оставляют в течение ночи, нагревая до комнатной температуры, и затем отгоняют растворитель. Остаток выливают на лед, экстрагируют уксусной кислотой, сушат и отгоняют растворитель. После хроматографической очистки на силикагеле (циклогексан/этиловый эфир уксусной кислоты 1:1) получают 284 мг (34% от теор.) желательного соединения.

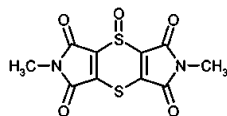
Получение (1,3,5,7-тетраоксо-1,3,5,7-тетрагидро-2Н,6Н-[1,4]-дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-2,6-диил)дипропан-1,2-диилдиацетат [соединение № (36)]



К раствору 1,1 г (3,72 ммоль) 1-(3,4-дихлор-2,5-диоксо-2,5-дигидро-1Н-пиррол-1-ил)пропан-2-илацетата в 10 мл этанола добавляют 0,283 г (3,72 ммоль) тиомочевины и перемешивают в течение 5 ч при температуре 40°C. После охлаждения до комнатной температуры отсасывают зеленые кристаллы, затем промывают их водой/этанолом. Фильтрат экстрагируют водой и этиловым эфиром уксусной ки-

слоты, сушат и отгоняют растворитель. Маточный шлолк чистят хроматографически на силикагеле (градиент циклогексан/этиловый эфир уксусной кислоты 0% → 100%). Получают 0,334 г (39,5% от теор.) желательного соединения.

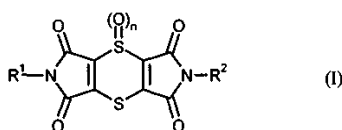
Получение 2,6-диметил-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)тетрон-4-оксида [соединение № (38)]



К 20 мл охлажденной льдом (5°C) дымящей азотной кислоты добавляют при перемешивании 3 г (10,63 ммоль) 2,6-диметил-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)-тетрона [соединение № (1)]. После полного растворения продолжают перемешивание еще в течение 5 мин, затем выливают на ледяную воду и отсасывают желтые кристаллы. Получают 2,56 г (80,8% от теор.) желательного соединения.

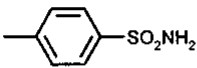
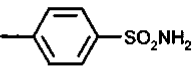
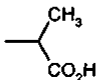
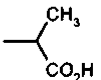
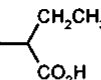
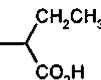
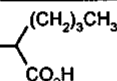
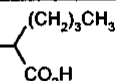
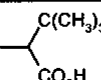
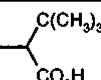
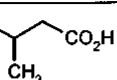
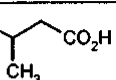
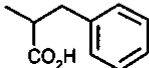
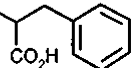
Аналогично приведенным выше примерам, а также в соответствии с общими описаниями способов можно получить приведенные в табл. 1 соединения формулы (I).

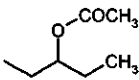
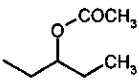
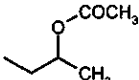
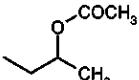
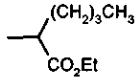
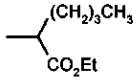
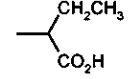
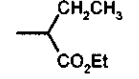
Таблица 1.



№.	R ¹	R ²	n	Физические данные
1	Me	Me	0	Log P = 2,32

№.	R ¹	R ²	n	Физические данные
2	Et	Et	0	¹ H-ЯМР (400 МГц, ДМСО-d ₆): δ = 1,096; 3,442 млн. долей
3	nPr	nPr	0	¹ H-ЯМР (400 МГц, ДМСО-d ₆): δ = 0,822; 1,566; 3,362 млн. долей
4	iPr	iPr	0	Log P = 4,19
5	cPr	cPr	0	¹ H-ЯМР (400 МГц, ДМСО-d ₆): δ = 0,50 – 0,89 млн. долей
6	-CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₃	0	Log P = 3,41
7	1-(трифторметил)- циклопропил	1-(трифторметил)- циклопропил	0	Log P = 4,03
8	H	H	0	Log P = 1,13
9	3,5-дихлорфенил	3,5-дихлорфенил	0	T _{пл} > 300°C
10	Ph	Ph	0	T _{пл} > 300°C
11	Bz	Bz	0	Log P = 4,60
12	2-метоксиэтил	2-метоксиэтил	0	Log P = 2,55
13	2-гидроксипропил	2-гидроксипропил	0	Log P = 2,27
14	2-гидроксипропил	2-гидроксипропил	0	Log P = 1,63
15	2-феноксиэтил	2-феноксиэтил	0	Log P = 3,86
16	2-этоксипропил	2-этоксипропил	0	Log P = 3,24
17	2-фенилпропан-2-ил	2-фенилпропан-2-ил	0	¹ H-ЯМР (400 МГц, ДМСО-d ₆): δ = 7,20 – 7,35 млн. долей
18	1-фенилэтил	1-фенилэтил	0	¹ H-ЯМР (400 МГц, ДМСО-d ₆): δ = 5,197; 5,215; 5,234; 5,251 млн. долей
19	2-метокси-2- метилпропил	2-метокси-2- метилпропил	0	
20	tBu	tBu	0	
21	-(CH ₂) ₂ OC(=O)CH ₃	-(CH ₂) ₂ OC(=O)CH ₃	0	¹ H-ЯМР (400 МГц, ДМСО-d ₆): δ = 1,053; 3,654; 4,110 млн. долей

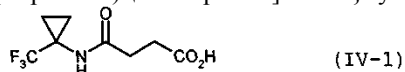
№.	R ¹	R ²	n	Физические данные
22			0	¹ H-ЯМР (400 МГц, ДМСО-d ₆): δ = 7,492; 7,596; 7,583; 7,946; 7,966 млн.долей
23	-CH ₂ CO ₂ H	-CH ₂ CO ₂ H	0	¹ H-ЯМР (400 МГц, ДМСО-d ₆): δ = 4,166 млн.долей
24			0	Log P = 1,76
25			0	
26			0	
27			0	¹ H-ЯМР (400 МГц, ДМСО-d ₆): δ = 1,620 млн.долей
28			0	Log P = 1,99
29	-(CH ₂) ₄ CO ₂ H	-(CH ₂) ₄ CO ₂ H	0	Log P = 2,02
30	3-(трифторметил)-циклогексил	3-(трифторметил)-циклогексил	0	¹³ C-ЯМР (150 МГц, ДМСО-d ₆): δ = 23,01; 23,71; 27,85; 28,61; 49,19; 126,77; 128,62; 130,56; 164,22 млн.долей
31	3-(трифторметил)-фенил	3-(трифторметил)-фенил	0	Log P = 4,91
32			0	Log P = 3,12
33	2-гидроксиэтил	2-гидроксиэтил	0	¹ H-ЯМР (400 МГц, ДМСО-d ₆): δ = 3,480 млн.долей
34	2-гидрокси-2-метилпропил	2-гидрокси-2-метилпропил	0	Log P = 3,65

№	R ¹	R ²	n	Физические данные
35			0	Log P = 3,09
36			0	Log P = 3,09
37	Гидроксиметил	Гидроксиметил	0	¹ H-ЯМР (400 МГц, ДМСО-d ₆): δ = 3,135; 4,789 млн. долей
38	Me	Me	1	T _{пл} 205°C
39	H	Et	0	Log P = 2,13
40			0	Log P = 4,66
41			0	Log P = 1,73

ДМСО = диметилсульфоксид, T_{пл} = температура плавления, Me = метил, Et = этил, nPr = н-пропил, iPr = изопропил, cPr = циклопропил, tBu = трет-бутил, Bz = бензил, Ph = фенил.

Получение исходных веществ формулы (IV)

Получение 4-оксо-4-[[1-(трифторметил)циклопропил]амино]бутановой кислоты (IV-1)



К раствору 496 мг (4,96 ммоль) ангидрида янтарной кислоты в 10 мл диоксана медленно добавляют при охлаждении льдом (10°C) 800,7 мг (4,96 ммоль) 1-(трифторметил)циклопропанамин и 0,85 мл (4,96 ммоль) диизопропилэтиламина. Перемешивают в течение 20 мин при комнатной температуре и выдерживают в течение ночи при этой температуре. Снова перемешивают при температуре 80°C в течение 20 мин, охлаждают до комнатной температуры и отгоняют растворитель. Многократно промывают попеременно этиловым эфиром уксусной кислоты и водой. Объединенные органические фазы сушат и отгоняют растворитель. Получают 815,8 мг (73% от теор.) желательного соединения.

Измерение logP - значений, приведенных в таблице и примерах получения, осуществлено согласно инструкции ЕЕС Directive 79/831 Annex V.A8 с помощью ЖХВР (жидкостной хроматографии высокого разрешения) на хроматографических колонках с реверсной фазой (С 18). Температура: 43°C.

Определение проводят в кислой области при значениях рН 2,7 с 0,1% водной муравьиной кислотой и ацетонитрилом (содержит 0,1% муравьиной кислоты) в качестве элюента; линейный градиент от 10% ацетонитрила до 95% ацетонитрила.

Градуировку проводят с помощью неразветвленных алкан-2-онов (с 3-16 атомами углерода), для которых известны logP-значения (определение LogP-значений проводят, опираясь на времена удерживания с линейной интерполяцией между двумя последовательными гомологами алканов).

Примеры применения

Пример А: Тест на *Phytophthora* (томаты)/защитный

Растворитель : 24,5 вес.ч. ацетона,
24,5 вес.ч. диметилацетамида.

Эмульгатор : 1 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для приготовления необходимого препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с указанными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Для испытания защитной эффективности молодые растения опрыскивают указанным расходным количеством препарата биологически активного вещества. После высыхания налета от опрыскивания растения инокулируют водной суспензией спор *Phytophthora infestans*. После этого растения помещают в инкубационную кабину при температуре около 20°C и относительной влажности воздуха 100%.

Спустя 3 дня после инокуляции происходит оценка. При этом 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности контроля, тогда как эффективность 100% означает, что не наблюдается никакого поражения.

В этом тесте в соответствии с изобретением соединения 1, 2 и 3 при концентрации биологически

активного вещества 250 млн. долей показывают эффективность 70% или более.

Пример В: Тест на *Plasmopara* (виноград)/защитный

Растворитель : 24,5 вес.ч. ацетона,
24,5 вес.ч. диметилацетамида.

Эмульгатор : 1 вес.ч. алкиларилполиглицолевого эфира.

Для приготовления необходимого препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с указанными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Для испытания защитной эффективности молодые растения опрыскивают указанным расходным количеством препарата биологически активного вещества. После высыхания налета от опрыскивания растения инокулируют водной суспензией спор *Plasmopara viticola* и оставляют на 1 день в инкубационной кабине при температуре около 20°C и относительной влажности воздуха 100%. Затем растения помещают на 4 дня в теплицу при температуре около 21°C и относительной влажности воздуха около 90%. Растения увлажняют и помещают на 1 день в инкубационную кабину.

Спустя 6 дней после инокуляции происходит оценка. При этом 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности контроля, тогда как эффективность 100% означает, что не наблюдается никакого поражения.

В этом тесте в соответствии с изобретением соединения 1, 2 и 3 при концентрации биологически активного вещества 250 млн. долей показывают эффективность 70% или более.

Пример С: Тест на *Venturia* (яблони)/защитный

Растворитель : 24,5 вес.ч. ацетона,
24,5 вес.ч. диметилацетамида.

Эмульгатор : 1 вес.ч. алкиларилполиглицолевого эфира.

Для приготовления необходимого препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с указанными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Для испытания защитной эффективности молодые растения опрыскивают указанным расходным количеством препарата биологически активного вещества. После высыхания налета от опрыскивания растения инокулируют водной суспензией конидий возбудителя парши яблوك *Venturia inaequalis* и оставляют на 1 день в инкубационной кабине при температуре около 20°C и относительной влажности воздуха 100%. Затем растения помещают в теплицу при температуре около 21°C и относительной влажности воздуха около 90%.

Спустя 10 дней после инокуляции происходит оценка. При этом 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности контроля, тогда как эффективность 100% означает, что не наблюдается никакого поражения.

В этом тесте в соответствии с изобретением соединения 1, 2 и 3 при концентрации биологически активного вещества 250 млн. долей показывают эффективность 70% или более.

Пример D: Тест на *Alternaria* (томаты)/защитный

Растворитель : 24,5 вес.ч. ацетона,
24,5 вес.ч. диметилацетамида.

Эмульгатор : 1 вес.ч. алкиларилполиглицолевого эфира.

Для приготовления необходимого препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с указанными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Для испытания защитной эффективности молодые растения опрыскивают указанным расходным количеством препарата биологически активного вещества. После высыхания налета от опрыскивания растения инокулируют водной суспензией спор *Alternaria solani*. После этого растения помещают в инкубационную кабину при температуре около 20°C и относительной влажности воздуха 100%.

Спустя 3 дня после инокуляции происходит оценка. При этом 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности контроля, тогда как эффективность 100% означает, что не наблюдается никакого поражения.

В этом тесте в соответствии с изобретением соединения 1, 2 и 3 при концентрации биологически активного вещества 250 млн. долей показывают эффективность 70% или более.

Пример E: Тест на *Botrytis* (огурцы)/защитный

Растворитель: 49 вес.ч. N,N-диметилформамида.

Эмульгатор : 1 вес.ч. алкиларилполиглицолевого эфира.

Для приготовления необходимого препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с указанными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Для испытания защитной эффективности молодые растения огурцов опрыскивают указанным расходным количеством препарата биологически активного вещества. Через 1 день после обработки растения инокулируют суспензией спор *Botrytis cinerea* и оставляют стоять в течение 48 ч при относительной

влажности воздуха 100% и температуре 22°C. Затем растения выдерживают при относительной влажности воздуха 96% и температуре 14°C.

Спустя 5-6 дней после инокуляции происходит оценка. При этом 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности контроля, тогда как эффективность 100% означает, что не наблюдается никакого поражения.

В этом тесте в соответствии с изобретением соединения 1, 2 и 3 при концентрации биологически активного вещества 500 млн. долей показывают эффективность 70% или более.

Пример F: Тест на *Rugophora teres* (ячмень)/защитный

Растворитель: 50 вес.ч. N,N-диметилацетамида.

Эмульгатор : 1 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для приготовления необходимого препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с указанными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

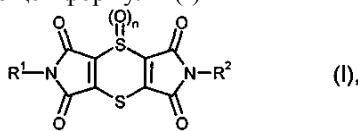
Для испытания защитной эффективности молодые растения опрыскивают указанным расходным количеством препарата биологически активного вещества. После высыхания налета от опрыскивания растения опрыскивают водной суспензией спор *Rugophora teres*. Растения помещают в инкубационную кабину на 48 ч при температуре около 20°C и относительной влажности воздуха 100%. Затем растения помещают в теплицу при температуре около 20°C и относительной влажности воздуха около 80%.

Спустя 8 дней после инокуляции происходит оценка. При этом 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности контроля, тогда как эффективность 100% означает, что не наблюдается никакого поражения.

В этом тесте в соответствии с изобретением соединения 1 при концентрации биологически активного вещества 1000 млн долей показывает эффективность 70% или более.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Дитиинтетракарбоксимиды общей формулы (I)



в которой

R¹ и R² одинаковы или различны и означают водород, не замещенный или замещенный однократно или многократно фтором, хлором, бромом, радикалом -OR³, радикалом -COR⁴ (C₁-C₆)алкил, не замещенный или замещенный однократно или многократно хлором, метилом или трифторметилом (C₃-C₇)циклоалкил, в каждом случае не замещенный или замещенный однократно или многократно фтором, хлором, бромом, метилом, трифторметилом, радикалом -COR⁴ или сульфоаминогруппой фенил или фенил-((C₁-C₄)алкил),

R³ означает водород, метил, этил, метилкарбонил, этилкарбонил или означает не замещенный или замещенный однократно или многократно фтором, хлором, метилом, этилом, n-пропилом, изопропилом или трифторметилом фенил,

R⁴ означает гидроксигруппу, метил, этил, метокси- или этоксигруппу,

n означает 0 или 1,

или их соли, предназначенные для борьбы с фитопатогенными грибами.

2. Дитиинтетракарбоксимиды по п.1, отличающиеся тем, что

R¹ и R² одинаковы или различны и означают водород, не замещенный или замещенный однократно или многократно фтором, хлором, гидроксигруппой, метокси-, этокси-, метилкарбонил- или метилкарбонил-оксигруппой, карбоксил-ом (C₁-C₄)алкил, не замещенный или замещенный однократно или многократно хлором, метилом или трифторметилом (C₃-C₇)циклоалкил, означают в каждом случае не замещенный или замещенный от однократно до трехкратно фтором, хлором, бромом, метилом, трифторметилом, радикалом -COR⁴, сульфоаминогруппой фенил, бензил, 1-фенэтил, 2-фенэтил или 2-метил-2-фенэтил,

R³ означает водород, метил, метилкарбонил или означает фенил,

R⁴ означает гидроксигруппу, метокси- или метоксигруппу,

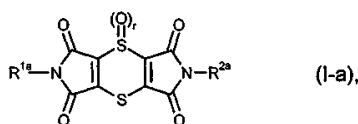
n означает 0 или 1.

3. Дитиинтетракарбоксимиды по п.1, отличающиеся тем, что R¹ и R² одновременно означают метил.

4. Средство для борьбы с фитопатогенными грибами, отличающееся тем, что содержит как минимум один дитиинтетракарбоксимид формулы (I) или его соль по п.1, а также наполнители и/или поверхностно-активные вещества.

5. Способ борьбы с фитопатогенными грибами, отличающийся тем, что на грибы и/или на среду их обитания наносят дитиинтетракарбоксимиды формулы (I) или их соли по п.1.

6. Дитиинтетракарбоксимиды формулы (I-a)



в которой

R^{1a} и R^{2a} одинаковы или различны и означают однократно или многократно замещенный фтором, радикалом $-OR^{3a}$, радикалом $-COR^{4a}$ (C_1-C_8) алкил, не замещенный или замещенный однократно или многократно галоидом, (C_1-C_4) алкилом или (C_1-C_4) галоидалкилом (C_3) циклоалкил, или означают однократно замещенный радикалом $-COR^{4a}$ в алкильной части арил-((C_1-C_4) алкил),

R^{3a} означает (C_1-C_4) алкил или означает не замещенный или замещенный однократно или многократно галоидом, (C_1-C_4) алкилом или (C_1-C_4) галоидалкилом арил,

R^{4a} означает гидроксигруппу, (C_1-C_4) алкил или (C_1-C_4) алкоксигруппу,

г означает 0 или 1,

причем R^{1a} и R^{2a} одновременно не могут означать ацетоксиметил или метоксиметил.

7. Дитиинтетракарбоксимиды формулы (I-a) по п.6, в которой

R^{1a} и R^{2a} одинаковы или различны и означают однократно или многократно замещенный фтором, радикалом $-OR^{3a}$, радикалом $-COR^{4a}$ (C_1-C_6) алкил, не замещенный или замещенный однократно или многократно хлором, метилом или трифторметилом (C_3) циклоалкил, или означают однократно замещенный радикалом $-COR^{4a}$ в алкильной части фенил-((C_1-C_4) алкил),

R^{3a} означает метил, этил или означает не замещенный или замещенный однократно или многократно фтором, хлором, метилом, этилом, н-пропилом, изопропилом или трифторметилом фенил,

R^{4a} означает гидроксигруппу, метил, этил, метокси- или этоксигруппу,

г означает 0 или 1,

причем R^{1a} и R^{2a} не означают ацетоксиметил.

8. Дитиинтетракарбоксимиды формулы (I-a) по п.6 или 7, в которой

R^{1a} и R^{2a} одинаковы или различны и означают однократно или многократно замещенный фтором, гидрокси-, метокси-, этокси-, метилкарбонилксигруппой, карбоксилем (C_1-C_4) алкил, не замещенный или замещенный однократно или многократно хлором, метилом или трифторметилом (C_3) циклоалкил, или означают однократно замещенный радикалом $-COR^{4a}$ в алкильной части 1-фенэтил или 2-фенэтил,

R^{4a} означает гидрокси- или метоксигруппу,

г означает 0,

причем R^{1a} и R^{2a} не означают ацетоксиметил.

