

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(11) **021116**

(13) **B1**

(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ**

(45) Дата публикации и выдачи патента
2015.04.30

(21) Номер заявки
201291334

(22) Дата подачи заявки
2011.05.24

(51) Int. Cl. **C07D 277/24** (2006.01)
C07D 417/04 (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01)

(54) **ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИЕ ПРОИЗВОДНЫЕ АЛКАНОЛОВ В КАЧЕСТВЕ
ФУНГИЦИДОВ**

(31) **10164143.9; 61/350,522**

(32) **2010.05.27; 2010.06.02**

(33) **EP; US**

(43) **2013.05.30**

(86) **PCT/EP2011/058442**

(87) **WO 2011/147816 2011.12.01**

(71)(73) Заявитель и патентовладелец:
**БАЙЕР ИНТЕЛЛЕКТУЭЛЬ
ПРОПЕРТИ ГМБХ (DE)**

(56) EP-A1-0409418
EP-A2-0395175

(72) Изобретатель:
**Низинг Карл Фридрих, Хельмке
Хендрик (DE), Кристо Пьер (FR),
Перис Горка, Тсучиа Томоки, Вазнер
Пьер, Бентинг Юрген (DE)**

(74) Представитель:
Юрчак Л.С. (KZ)

(57) Изобретение относится к новым гетероциклическим производным алканолов, к способам получения этих соединений, к средствам, содержащим эти соединения, а также к их применению в качестве биологически активных соединений, в частности, для борьбы с вредными микроорганизмами при защите растений и защите материалов, а также в качестве регуляторов роста растений.

021116
B1

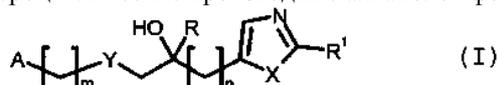
021116
B1

Данное изобретение относится к новым гетероциклическим производным алканолов, к способам получения этих соединений, к средствам, содержащим эти соединения, а также к их применению в качестве биологически активных соединений, в частности, для борьбы с вредными микроорганизмами при защите растений и защите материалов, а также в качестве регуляторов роста растений.

Известно, что определенные гетероциклические производные алканолов могут применяться при защите растений в качестве фунгицидов и/или регуляторов роста растений (см. EP-A 0395175, EP-A 0409418).

В связи с тем, что экологические и экономические требования к современным биологически активным веществам, например фунгицидам, постоянно возрастают, например, в том, что касается спектра действия, токсичности, селективности, расходного количества, образования остатков и удобства получения, и также в связи с тем, что возникают, например, проблемы, связанные с возникновением устойчивости к ним, существует постоянная задача по созданию новых фунгицидов, которые, как минимум, в отдельных областях имеют преимущества по сравнению с известными веществами.

Были открыты новые гетероциклические производные алканолов формулы (I)



в которой X означает O или S ;

Y означает O , $-CH_2-$ или простую химическую связь;

m означает 0 или 1;

n означает 0 или 1;

R каждый означает незамещенный или замещенный алкил, алкенил, циклоалкил или арил;

R^1 означает водород, SH , алкилтио-, алкоксигруппу, галоид, галоидалкил, галоидалкилтио-, галоидалкокси-, циано-, нитрогруппу или $Si(\text{алкил})_3$;

A означает в каждом случае трижды замещенный заместителем Z фенил или нафтил, причем заместители Z одинаковы или различны;

Z означает галоид, циано-, нитрогруппу, OH , SH , $C(\text{алкил})(=NO\text{-алкил})$, (C_3-C_7) циклоалкил, (C_1-C_4) алкил, (C_1-C_4) галоидалкил, (C_1-C_4) алкокси-, (C_1-C_4) галоидалкокси-, (C_1-C_4) алкилтио-, (C_1-C_4) галоидалкилтиогруппу, (C_2-C_4) алкенил, (C_2-C_4) галоидалкенил, (C_2-C_4) алкинил, (C_2-C_4) галоидалкинил, (C_1-C_4) алкилсульфинил, (C_1-C_4) галоидалкилсульфинил, (C_1-C_4) алкилсульфонил, (C_1-C_4) галоидалкилсульфонил, формил, (C_2-C_5) алкилкарбонил, (C_2-C_5) галоидалкилкарбонил, (C_2-C_5) алкоксикарбонил, (C_2-C_5) галоидалкоксикарбонил, (C_3-C_6) алкенилокси-, (C_3-C_6) алкинилокси-, (C_2-C_5) алкилкарбонилокси-, (C_2-C_5) галоидалкилкарбонилоксигруппу, триалкилсилил, или означает в каждом случае не замещенные или монозамещенные галоидом, (C_1-C_4) алкилом, (C_1-C_4) галоидалкилом, (C_1-C_4) алкоксигруппой или (C_2-C_4) алкилкарбонилем фенил, фенокси- или фенилтиогруппу,

а также их агрохимически действующие соли.

Полученные соли также обладают фунгицидными и/или регулирующими рост растений свойствами.

Применяемые согласно данному изобретению гетероциклические производные алканолов определяются в общем виде формулой (I). Далее приведены предпочтительные значения радикалов в приведенной выше формуле и в формулах, которые будут приведены ниже. Эти значения справедливы в равной мере как для конечных продуктов формулы (I), так и для всех промежуточных продуктов (см. также ниже в разделе "Пояснения к способам и промежуточным продуктам").

X предпочтительно означает S .

X также предпочтительно означает O .

Y предпочтительно означает O .

Y также предпочтительно означает $-CH_2-$.

Y также предпочтительно означает простую химическую связь.

Y более предпочтительно означает O .

Y также более предпочтительно означает $-CH_2-$.

m предпочтительно означает 0.

m также предпочтительно означает 1.

n предпочтительно означает 0.

n также предпочтительно означает 1.

R предпочтительно означает в каждом случае линейный или разветвленный (C_3-C_7) алкил, (C_1-C_3) галоидалкил, (C_2-C_7) алкенил, (C_2-C_7) галоидалкенил, не замещенный или замещенный галоидом, (C_1-C_4) алкилом, (C_1-C_4) галоидалкилом, (C_1-C_4) алкокси-, (C_1-C_4) галоидалкокси-, (C_1-C_4) галоидалкилтио- или (C_1-C_4) алкилтиогруппой (C_3-C_7) циклоалкил, а также означает не замещенный или замещенный от однократно до трехкратно галоидом или (C_1-C_4) алкилом фенил.

R более предпочтительно означает в каждом случае линейный или разветвленный (C_3-C_5) алкил, (C_1-C_6) галоидалкил, (C_3-C_5) алкенил, (C_3-C_5) галоидалкенил, означает не замещенный или замещенный галоидом

дом, (C₁-C₄)алкилом, (C₁-C₄)галоидалкилом, (C₁-C₄)галоидалкокси-, (C₁-C₄)алкокси-, (C₁-C₄)галоидалкилтио- или (C₁-C₄)алкилтиогруппой (C₃-C₆)циклоалкил.

R еще более предпочтительно означает трет-бутил, изопропил, 1-хлорциклопропил, 1-фторциклопропил, 1-метилциклопропил, 1-метоксициклопропил, 1-метилтиоциклопропил, 1-трифторметилциклопропил, (3E)-4-хлор-2-метилбут-3-ен-2-ил, (C₁-C₄)галоидалкил.

R¹ предпочтительно означает водород, SH, (C₁-C₄)алкилтио-, (C₁-C₄)алкоксигруппу или галоид.

R¹ более предпочтительно означает водород, SH, метилтио-, этилтио-, метокси-, этоксигруппу, фтор, хлор, бром или йод.

A предпочтительно означает в каждом случае трехкратно замещенный радикалом Z фенил, причем радикалы Z одинаковы или различны.

A более предпочтительно означает замещенный во 2-, 3- и 4-положении радикалом Z фенил, причем радикалы Z одинаковы или различны.

A также более предпочтительно означает замещенный во 2-, 4- и 6-положении радикалом Z фенил, причем радикалы Z одинаковы или различны.

A также более предпочтительно означает замещенный в 3-, 4- и 5-положении радикалом Z фенил, причем радикалы Z одинаковы или различны.

A также более предпочтительно означает замещенный во 2-, 4- и 5-положении радикалом Z фенил, причем радикалы Z одинаковы или различны.

A предпочтительно означает трехкратно замещенный радикалом Z нафтил, причем радикалы Z одинаковы или различны.

A более предпочтительно означает трехкратно замещенный радикалом Z 1-нафтил, причем радикалы Z одинаковы или различны.

A также более предпочтительно означает трехкратно замещенный радикалом Z 2-нафтил, причем радикалы Z одинаковы или различны.

Z предпочтительно означает галоид, циано-, нитрогруппу, C((C₁-C₅)алкил) (=NO((C₁-C₅)алкил)), (C₃-C₆)циклоалкил, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)галоидалкил, (C₁-C₄)алкокси-, (C₁-C₄)галоидалкокси-, (C₁-C₄)алкилтио-, (C₁-C₄)галоидалкилтиогруппу, (C₂-C₄)алкенил, (C₂-C₄)алкинил, (C₁-C₄)алкилсульфинил, (C₁-C₄)алкилсульфонил, (C₂-C₃)алкилкарбонил, (C₂-C₃)алкоксикарбонил, (C₃-C₆)алкенилокси-, (C₃-C₆)алкинилокси-, (C₂-C₃)алкилкарбонилоксигруппу, или означает в каждом случае не замещенный или монозамещенный галоидом, (C₁-C₄)алкилом, (C₁-C₄)галоидалкилом, (C₁-C₄)алкоксигруппой или (C₂-C₄)алкилкарбонил фенил, фенокси- или фенилтиогруппу.

Z более предпочтительно означает галоид, циано-, нитрогруппу, C((C₁-C₄)алкил) (=NO((C₁-C₄)алкил)), (C₃-C₆)циклоалкил, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₂)галоидалкил, (C₁-C₂)алкокси-, (C₁-C₂)галоидалкокси-, (C₁-C₂)алкилтио-, (C₁-C₂)галоидалкилтиогруппу, (C₁-C₂)алкилсульфинил, (C₁-C₂)алкилсульфонил, ацетил, метоксикарбонил, этоксикарбонил, метилкарбонилоксигруппу или означает в каждом случае не замещенный или монозамещенный галоидом, (C₁-C₂)алкилом, (C₁-C₂)галоидалкилом, (C₁-C₂)алкоксигруппой, ацетилом фенил, фенокси- или фенилтиогруппу.

Z еще более предпочтительно означает фтор, хлор, бром, йод, циано-, нитрогруппу, CH(=NOMe), циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, метил, этил, н-пропил, изопропил, н-, изо-, втор- или трет-бутил, трифторметил, трихлорметил, дифторметил, дихлорметил, дифторхлорметил, метокси-, трифторметокси-, дифторметокси-, метилтио-, трифторметилтио-, дифторметилтиогруппу или означает в каждом случае не замещенный или монозамещенный фтором, хлором, бромом, йодом, метилом, этилом, трифторметилом, трихлорметилом, дифторметилом, дихлорметилом, дифторхлорметилом, метоксигруппой, ацетилом фенил, фенокси- или фенилтиогруппу.

Приведенные выше общие и предпочтительные значения радикалов, соответственно, пояснения могут, однако, также комбинироваться между собой, т.е. между любыми областями значений комбинироваться любым образом. Они справедливы как для конечных продуктов, так и для исходных и промежуточных продуктов соответственно. Кроме того, некоторые значения могут выпадать.

Предпочтительны такие соединения формулы (I), в которой все радикалы в каждом случае имеют приведенные выше предпочтительные значения.

Более предпочтительны такие соединения формулы (I), в которой все радикалы в каждом случае имеют приведенные выше более предпочтительные значения.

Еще более предпочтительны такие соединения формулы (I), в которой все радикалы в каждом случае имеют приведенные выше еще более предпочтительные значения.

Далее предпочтительны соединения формулы (I), в которой Y означает кислород.

Далее предпочтительны соединения формулы (I), в которой Y означает -CH₂-.

Далее предпочтительны соединения формулы (I), в которой Y означает простую химическую связь.

Далее предпочтительны соединения формулы (I), в которой R означает трет-бутил.

Далее предпочтительны соединения формулы (I), в которой R означает 1,3-дифтор-2-метилпропан-2-ил.

Далее предпочтительны соединения формулы (I), в которой R означает 1-метилциклопропил.

Далее предпочтительны соединения формулы (I), в которой R означает 1-фторциклопропил.

Далее предпочтительны соединения формулы (I), в которой R означает 1-хлорциклопропил.

Далее предпочтительны соединения формулы (I), в которой R означает изопропил.

Далее предпочтительны соединения формулы (I), в которой R означает 1-метилциклогексил.

Далее предпочтительны соединения формулы (I), в которой n означает 0.

Далее предпочтительны соединения формулы (I), в которой n означает 1.

Далее предпочтительны соединения формулы (I), в которой X означает серу.

Далее предпочтительны соединения формулы (I), в которой R¹ означает водород.

Далее предпочтительны соединения формулы (I), в которой R¹ означает SH.

Приведенные выше значения радикалов, соответственно, пояснения могут комбинироваться между собой любым образом. Кроме того отдельные значения могут выпадать.

В определениях символов для приведенных выше формул были использованы собирательные понятия, которые являются общепредставительными для следующих заместителей:

Галоид: (также и в таких комбинациях, как галоидалкил, галоидалкоксигруппа и т.д.) означает фтор, хлор, бром и йод. Алкил: (также и в таких комбинациях, как алкилтио-, алкоксигруппа и т.д.) означает насыщенные, линейные или разветвленные углеводородные радикалы, содержащие 1-8 атомов углерода, например, (C₁-C₆)алкил, такие как метил, этил, пропил, 1-метилэтил, бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, гексил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этил-1-метилпропил и 1-этил-2-метилпропил; гептил, октил.

Галоидалкил: (также в таких комбинациях, как галоидалкилтио-, галоидалкоксигруппа и т.д.) означает насыщенные, линейные или разветвленные углеводородные радикалы, содержащие 1-8 атомов углерода (как пояснено выше), причем в этих группах атомы водорода частично или полностью могут быть замещены атомами галоида, как пояснено выше, например, (C₁-C₃)галоидалкил, такой как хлорметил, бромметил, дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорфторметил, дихлорфторметил, хлордифторметил, 1-хлорэтил, 1-бромэтил, 1-фторэтил, 2-фторэтил, 2,2-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, 2-хлор-2-фторэтил, 2-хлор-2,2-дифторэтил, 2,2-дихлор-2-фторэтил, 2,2,2-трихлорэтил, пентафторэтил и 1,1,1-трифторпроп-2-ил.

Алкенил: означает не насыщенные, линейные или разветвленные углеводородные радикалы, содержащие 2-8 атомов углерода и одну двойную связь в любом положении, например, (C₂-C₆)алкенил, такой как этенил, 1-пропенил, 2-пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 1-метил-1-пропенил, 2-метил-1-пропенил, 1-метил-2-пропенил, 2-метил-2-пропенил, 1-пентенил, 2-пентенил, 3-пентенил, 4-пентенил, 1-метил-1-бутенил, 2-метил-1-бутенил, 3-метил-1-бутенил, 1-метил-2-бутенил, 2-метил-2-бутенил, 3-метил-2-бутенил, 1-метил-3-бутенил, 2-метил-3-бутенил, 3-метил-3-бутенил, 1,1-диметил-2-пропенил, 1,2-диметил-1-пропенил, 1,2-диметил-2-пропенил, 1-этил-1-пропенил, 1-этил-2-пропенил, 1-гексенил, 2-гексенил, 3-гексенил, 4-гексенил, 5-гексенил, 1-метил-1-пентенил, 2-метил-1-пентенил, 3-метил-1-пентенил, 4-метил-1-пентенил, 1-метил-2-пентенил, 2-метил-2-пентенил, 3-метил-2-пентенил, 4-метил-2-пентенил, 1-метил-3-пентенил, 2-метил-3-пентенил, 3-метил-3-пентенил, 4-метил-3-пентенил, 1-метил-4-пентенил, 2-метил-4-пентенил, 3-метил-4-пентенил, 4-метил-4-пентенил, 1,1-диметил-2-бутенил, 1,1-диметил-3-бутенил, 1,2-диметил-1-бутенил, 1,2-диметил-2-бутенил, 1,2-диметил-3-бутенил, 1,3-диметил-1-бутенил, 1,3-диметил-2-бутенил, 1,3-диметил-3-бутенил, 2,2-диметил-3-бутенил, 2,3-диметил-1-бутенил, 2,3-диметил-2-бутенил, 2,3-диметил-3-бутенил, 3,3-диметил-1-бутенил, 3,3-диметил-2-бутенил, 1-этил-1-бутенил, 1-этил-2-бутенил, 1-этил-3-бутенил, 2-этил-1-бутенил, 2-этил-2-бутенил, 2-этил-3-бутенил, 1,1,2-триметил-2-пропенил, 1-этил-1-метил-2-пропенил, 1-этил-2-метил-1-пропенил и 1-этил-2-метил-2-пропенил.

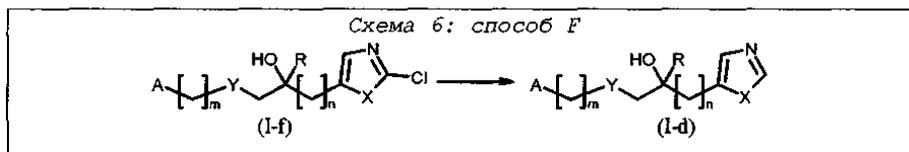
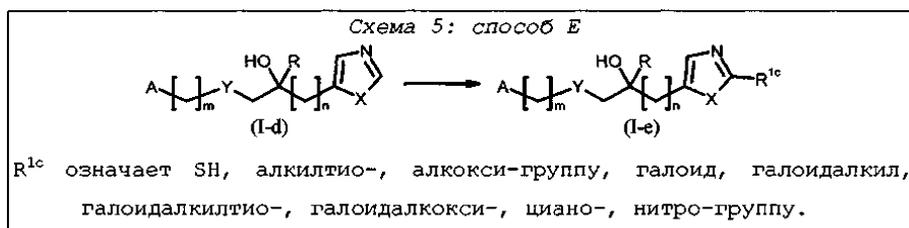
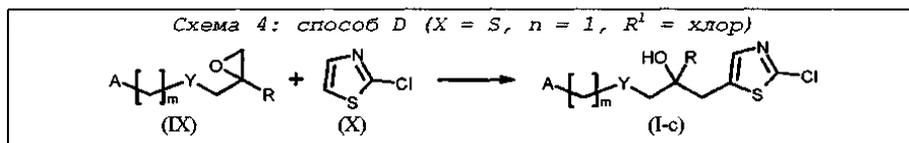
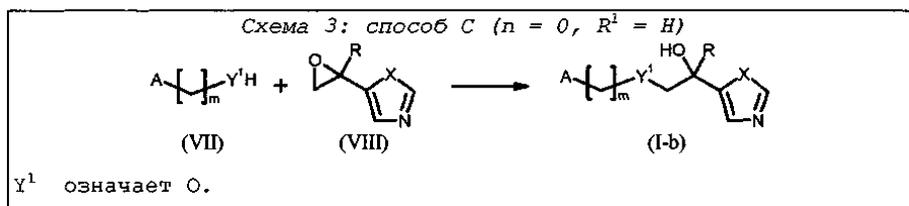
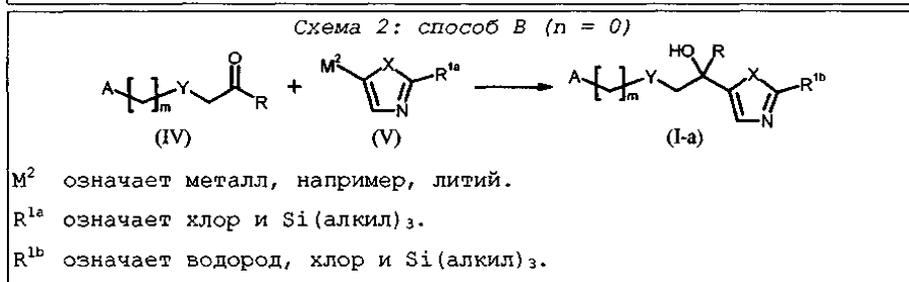
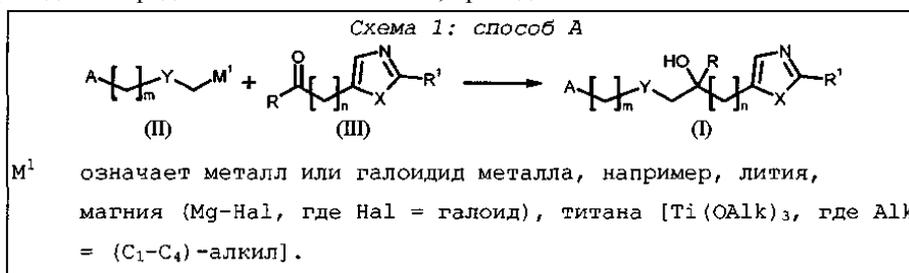
Циклоалкил: моноциклические, насыщенные углеводородные группы, содержащие 3-8 атомов углерода в кольце, такие как циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептил и циклооктил. Арил: не замещенное или замещенное, ароматическое, моно-, би- или трициклическое кольцо, например фенил, нафтил, антраценил (антрил), фенантраценил (фенантрил).

Гетарил: не замещенное или замещенное, не насыщенное гетероциклическое 5 - 7-членное кольцо, содержащее до 4 атомов азота или альтернативно 1 атом азота и до 2 других гетероатомов, выбираемых из N, O и S, например, 2-фурил, 3-фурил, 2-тиенил, 3-тиенил, 2-пирролил, 3-пирролил, 1-пирролил, 3-пиразолил, 4-пиразолил, 5-пиразолил, 1-пиразолил, 1H-имидазол-2-ил, 1H-имидазол-4-ил, 1H-имидазол-5-ил, 1H-имидазол-1-ил, 2-оксазолил, 4-оксазолил, 5-оксазолил, 2-тиазолил, 4-тиазолил, 5-тиазолил, 3-изоксазолил, 4-изоксазолил, 5-изоксазолил, 3-изотиазолил, 4-изотиазолил, 5-изотиазолил, 1H-1,2,3-триазол-1-ил, 1H-1,2,3-триазол-4-ил, 1H-1,2,3-триазол-5-ил, 2H-1,2,3-триазол-2-ил, 2H-1,2,3-триазол-4-ил, 1H-1,2,4-триазол-3-ил, 1H-1,2,4-триазол-5-ил, 1H-1,2,4-триазол-1-ил, 4H-1,2,4-триазол-3-ил, 4H-1,2,4-триазол-4-ил, 1H-тетразол-1-ил, 1H-тетразол-5-ил, 2H-тетразол-2-ил, 2H-тетразол-5-ил, 1,2,4-оксадиазол-3-ил, 1,2,4-оксадиазол-5-ил, 1,2,4-тиадиазол-3-ил, 1,2,4-тиадиазол-5-ил, 1,3,4-оксадиазол-2-ил, 1,3,4-тиадиазол-2-ил, 1,2,3-оксадиазол-4-ил, 1,2,3-оксадиазол-5-ил, 1,2,3-тиадиазол-4-ил, 1,2,3-тиадиазол-5-ил, 1,2,5-оксадиазол-3-ил, 1,2,5-тиадиазол-3-ил, 2-пиридилил, 3-пиридилил, 4-пиридилил, 3-пиридазил, 4-

пиридазинил, 2-пиримидинил, 4-пиримидинил, 5-пиримидинил, 2-пиазинил, 1,3,5-триазин-2-ил, 1,2,4-триазин-3-ил, 1,2,4-триазин-5-ил, 1,2,4-триазин-6-ил.

Пояснения относительно способов получения и промежуточных продуктов.

Гетероциклические производные алканолов формулы (I) могут быть получены различными путями (см. EP-A 0409418). Ниже схематически приведены возможные способы получения. Если особо не оговорено, то приведенные радикалы имеют значения, приведенные выше.



Предпочтительные значения радикалов в предшествующих формулах и в тех формулах, которые будут приведены далее, а также в схемах приведены выше. Эти значения радикалов справедливы не только для конечных продуктов формулы (I), но также и для всех промежуточных продуктов в равной мере.

Способ А.

Соединения формулы (II), использованные в качестве исходных веществ при проведении способа А согласно данному изобретению, отчасти известны. Их можно получить известным образом (см. Z. Anorg.

Allg. Chem. 2001, 627, 2408-2412).

Кетоны формулы (III), которые также использованы в качестве исходных веществ при проведении способа А согласно данному изобретению, являются известными соединениями (см. EP-A 0409418).

Способ А согласно данному изобретению обычно проводят в присутствии разбавителя, например, диэтиловый эфир, тетрагидрофуран или дихлорметан, при температуре от -80 до 80°C. Полученное соединение улавливают донором протонов. Взаимодействие согласно данному изобретению предпочтительно проводят в атмосфере инертного газа, более предпочтительно в атмосфере азота или аргона.

Способ В.

Кетоны формулы (IV), использованные в качестве исходных веществ при проведении способа В согласно данному изобретению, отчасти известны. Их можно получить известным образом (см. EP-A 0409418).

Металлоорганические гетероциклы формулы (V), которые также использованы в качестве исходных веществ при проведении способа В согласно данному изобретению, являются известными соединениями (см. EP-A 0409418 и EP-A 0395175).

При получении металлоорганических гетероциклов формулы (V) при необходимости является предпочтительным предусмотреть во 2-положении подходящую защитную группу, например триметилсил, для того чтобы регулировать (управлять) M² в 5-положении. Эту защитную группу можно, но не необходимо, отщепить перед реакцией с кетонами формулы (IV).

Способ В согласно данному изобретению обычно проводят в присутствии разбавителя, например тетрагидрофуран или диэтиловый эфир, при температуре от -120 до 80°C. Полученный продукт улавливают донором протонов.

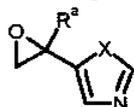
Взаимодействие согласно данному изобретению предпочтительно проводят в атмосфере инертного газа, более предпочтительно в атмосфере азота или аргона.

Способ С.

Соединения формулы (VII), использованные в качестве исходных веществ при проведении способа С согласно данному изобретению, известны.

Производные оксирана формулы (VIII), которые также использованы в качестве исходных веществ при проведении способа С согласно данному изобретению, отчасти известны.

Новыми являются производные оксирана формулы (VIII-a)



(VIII-a),

в которой X имеет значения, приведенные выше;

R^a означает в каждом случае при необходимости разветвленный алкил (за исключением трет-бутила, когда X означает S), алкенил, циклоалкил или арил.

R^a предпочтительно означает в каждом случае при необходимости разветвленный (C₃-C₇)алкил (за исключением трет-бутила, когда X означает S), (C₁-C₈)галоидалкил, (C₂-C₇)алкенил, (C₂-C₇)галоидалкенил, означает не замещенный или замещенный галоидом, (C₁-C₄)алкилом, (C₁-C₄)галоидалкилом, (C₁-C₄)алкокси-, (C₁-C₄)галоидалкокси-, (C₁-C₄)галоидалкилтио- или (C₁-C₄)алкилтиогруппой (C₃-C₇)циклоалкил, а также означает не замещенный или замещенный от однократно до трехкратно галоидом или (C₁-C₄)алкилом фенил.

R^a более предпочтительно означает в каждом случае при необходимости разветвленный (C₃-C₅)алкил (за исключением трет-бутила), (C₁-C₆)галоидалкил, (C₃-C₅)алкенил, (C₃-C₅)галоидалкенил, означает не замещенный или замещенный галоидом, (C₁-C₄)алкилом, (C₁-C₄)галоидалкилом, (C₁-C₄)алкокси-, (C₁-C₄)галоидалкокси-, (C₁-C₄)галоидалкилтио- или (C₁-C₄)алкилтиогруппой (C₃-C₆)циклоалкил.

R^a еще более предпочтительно означает изопропил, 1-хлорциклопропил, 1-фторциклопропил, 1-метилциклопропил, 1-метоксициклопропил, 1-метилтиоциклопропил, (3E)-4-хлор-2-метилбут-3-ен-2-ил, (C₁-C₄)галоидалкил.

Новые производные оксирана формулы (VIII-a) также являются предметом данного изобретения.

Способ С согласно данному изобретению проводят в присутствии разбавителя, например N,N-диметилформамида, и при необходимости в присутствии основания, например, гидрида натрия или карбоната калия.

Способ D.

Производные оксирана формулы (IX), использованные в качестве исходных веществ при проведении способа D согласно данному изобретению, отчасти известны (см. EP-A 0121171).

2-Хлор-1,3-тиазол формулы (X) известен.

Для превращения соединений IX могут применяться металлоорганические соединения, предпочтительно соединения алкиллития (например, n-бутиллитий) (см. EP-A 0395175).

Способ D согласно данному изобретению обычно проводят в присутствии разбавителя, например тетрагидрофурана или диэтилового эфира, при температуре от -120 до 80°C. Полученный продукт улав-

ливают донором протонов.

Взаимодействие согласно данному изобретению предпочтительно проводят в атмосфере инертного газа, более предпочтительно в атмосфере азота или аргона.

Способ E.

Соединения формулы (I-d), получаемые в рамках приведенных выше способов, можно подвергнуть дальнейшему превращению в целевые соединения общей структуры (I-e).

Для превращения соединений формулы (I-d) могут применяться металлоорганические соединения, предпочтительно соединения алкиллития (например, *n*-бутиллитий) (см. EP-A 0906292). Промежуточно образующееся металлоорганическое соединение обычно с помощью электрофильного соединения (например, серы, алкилгалоида или интергалойдного соединения) превращают в целевое соединение (I-e).

Способ E согласно данному изобретению обычно проводят в присутствии разбавителя, например тетрагидрофурана или диэтилового эфира, при температуре от -120 до 80°C. Полученный продукт улавливают донором протонов.

Взаимодействие согласно данному изобретению предпочтительно проводят в атмосфере инертного газа, более предпочтительно в атмосфере азота или аргона.

Способ F.

Соединения формулы (I-f), получаемые в рамках приведенных выше способов, можно подвергнуть дальнейшему превращению в целевые соединения общей структуры (I-d).

Для превращения соединений формулы (I-f) могут применяться металлы, предпочтительно цинк (см. EP-A 0395175).

Способ F согласно данному изобретению обычно проводят в присутствии разбавителя, например тетрагидрофурана, или также в присутствии органической кислоты, например уксусной кислоты, при температуре от -120 до 150°C.

Гетероциклические производные алканолов согласно данному изобретению общей формулы (I) можно перевести в соли присоединения к кислоте, соответственно, в комплексы с солями металлов.

Для получения физиологически переносимых солей присоединения к кислоте соединений общей формулы (I) подходят предпочтительно следующие кислоты: галоидисто-водородные кислоты, такие как, например, хлористо-водородная кислота и бромисто-водородная кислота, предпочтительно хлористо-водородная кислота, далее фосфорная кислота, азотная кислота, серная кислота, моно- и бифункциональные карбоновые кислоты и гидроксикарбоновые кислоты, такие как, например, уксусная кислота, малеиновая кислота, янтарная кислота, фумаровая кислота, винная кислота, лимонная кислота, салициловая кислота, сорбиновая кислота, молочная кислота, а также сульфоновые кислоты, такие как, например, *p*-толуолсульфоновая кислота и 1,5-нафталиндисульфоновая кислота. Соли присоединения к кислоте соединений общей формулы (I) могут быть простым путем получены обычными способами образования солей, например путем растворения соединения общей формулы (I) в подходящем инертном растворителе и добавления к раствору кислоты, например, хлористо-водородной кислоты, и выделения известным образом, например, фильтрованием и чисткой, при необходимости промыванием органическим растворителем.

Для получения комплекса с солями металлов соединений общей формулы (I) предпочтительно подходят соли металлов II-IV главной группы и I и II, а также IV-VIII побочной группы Периодической системы элементов, причем в качестве примера следует назвать медь, цинк, марганец, магний, олово, железо или никель.

В качестве анионов солей имеются в виду такие, которые предпочтительно происходят из следующих кислот: галоидисто-водородные кислоты, такие как, например, хлористо-водородная кислота и бромисто-водородная кислота, далее фосфорная кислота, азотная кислота и серная кислота. Комплексы с солями металлов соединений общей формулы (I) могут быть просто получены обычными способами, так, например, растворением соли металла в спирте, например, этаноле, и добавлением к соединению общей формулы I. Комплексы с солями металлов можно выделить известным образом, например, фильтрованием, и при необходимости очистить с помощью перекристаллизации.

Данное изобретение далее относится к средству защиты растений для борьбы с нежелательными микроорганизмами, в частности, с нежелательными грибами, которое включает биологически активные вещества согласно данному изобретению. Предпочтительно имеется в виду фунгицидное средство, которое содержит применяемые в сельском хозяйстве вспомогательные средства, растворители, носители, поверхностно-активные вещества или наполнители.

Наряду с этим, изобретение также относится к способу борьбы с нежелательными микроорганизмами, отличающемуся тем, что биологически активные вещества согласно данному изобретению наносят на фитопатогенные грибы и/или на среду их обитания.

Носитель означает согласно данному изобретению природное или синтетическое, органическое или неорганическое вещество, с помощью которого происходит лучшее применение биологически активного вещества, прежде всего для нанесения на растения или части растений, или семенной материал, в смешанном или связанном виде. Носители могут быть твердыми или жидкими, как правило, они инертны и должны быть применимыми в сельском хозяйстве.

В качестве твердых или жидких носителей подходят, например, аммониевые соли и мука природных горных пород, таких как каолин, глина, 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, предпочтительно 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, а также синтетические грануляты из муки неорганического и органического происхождения, и 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 при 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 применения воды в качестве наполнителя можно также использовать, например, органические растворители в качестве вспомогательных средств для растворения. В качестве жидких растворителей в существенной мере подходят ароматические соединения, такие как ксилол, толуол или алкилнафталины, хлорированные ароматические соединения 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 вода.

Средства согласно данному изобретению могут дополнительно содержать другие компоненты, такие как поверхностно-активные вещества. В качестве поверхностно-активных веществ подходят эмульгирующие и пенообразующие средства, диспергирующие или смачивающие средства с ионными или не ионными 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 жирными кислотами, или с жирными аминами, замещенные фенолы (предпочтительно алкилфенолы или арилфенолы), соли эфиров сульфоянтарной кислоты, производные тауриновой кислоты (предпочтительно алкилтаураты), эфиры фосфорной кислоты с полиэтоксилированными спиртами или фенолами, эфиры жирных кислот с полиолами и производные соединений, содержащих сульфаты, сульфонаты и фосфаты, например, алкиларилполигликолевые эфиры, алкилсульфонаты, алкилсульфаты, арилсульфонаты, гидролизаты яичного белка, лигнинсульфитовые щелоки и метилцеллюлоза. Присутствие поверхностно-активного вещества является необходимым, когда одно из биологически активных веществ и/или инертных носителей не растворимо в воде и когда применение происходит 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 содержаться другие дополнительные компоненты, например защитные коллоиды, связующие средства, клеящие вещества, загустители, тиксотропные вещества, способствующие проникновению вещества, стабилизаторы, комплексообразующие средства. Как правило, биологически активные вещества могут комбинироваться с любым твердым или жидким добавочным веществом, которое обычно используют при приготовлении препаратов.

Препараты и средства согласно данного изобретения обычно содержат 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, еще более предпочтительно от 10 до 70 вес.%.

Биологически активные вещества, соответственно, средства согласно данному изобретению сами по себе или в зависимости от их соответствующих физических и/или химических свойств могут находиться в виде их препаратов или приготовленных из них форм, готовых для применения, таких как аэрозоли, капсульные суспензии, концентраты холодного тумана, концентраты горячего тумана, закапсулованные грануляты, 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, диспергируемые в масле порошки, смешиваемые с маслом текучие концентраты, смешиваемые с маслом жидкости, пены, пасты, укутанный пес-

тицидами семенной материал, 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 мельчайшие капсулы в полимерных веществах и покровные массы для семенного материала, а также препараты в ультра малых объемах для образования холодного или теплого тумана.

Указанные препараты могут быть приготовлены известным образом, например смешиванием биологически активных веществ как минимум с одним обычным наполнителем, растворителем, соответственно разбавителем, эмульгатором, диспергирующим и/или связывающим или фиксирующим средством, смачивающим средством, водоотталкивающим средством, при необходимости сиккативами и УФ-стабилизаторами и при необходимости красителями и пигментами, противовспенивателями, консервирующими средствами, вторичными загустителями, клеями, гиббереллинами, а также другими вспомогательными для переработки веществами.

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

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

Обработку растений и частей растений согласно данному изобретению биологически активными веществами, соответственно, средствами производят непосредственно или воздействием на окружающую среду, на жизненное пространство или на складское помещение обычными способами обработки, например, окунанием, разбрызгиванием, опрыскиванием, обработкой тонкой струей, испарением, распылением, образованием тумана, рассыпанием, покрытием пеной, намазыванием, размазыванием, поливанием (промачиванием), капельным поливом и в случае материала для размножения, в частности, семян также путем сухого протравливания, мокрого протравливания, протравливания в шламе, инкрустирования, однослойного и многослойного покрывания и т.д. Далее возможно нанесение биологически активных веществ способом ультрамалых объемов или инжектированием препарата биологически активного вещества или самого биологически активного вещества в почву.

Изобретение далее охватывает способ обработки семенного материала.

Изобретение далее относится к семенному материалу, который обработан способом, описанным в одном из предыдущих абзацев. Семенной материал согласно данному изобретению находит применение в способе защиты семенного материала от нежелательных микроорганизмов. При этом применяется семенной материал, обработанный, как минимум, одним биологически активным веществом согласно данному изобретению.

Биологически активные вещества, соответственно, средства согласно данному изобретению также пригодны для обработки семенного материала. Большая часть вреда, наносимого культурным растениям вредными организмами, вызвана поражением вредителями семенного материала во время хранения или после посева, а также во время прорастания и сразу после него. Эта фаза является особенно критической, так как корни и ростки вырастающих растений особенно чувствительны и даже небольшие повреждения приводят к гибели растений. В связи с этим большой интерес состоит в том, чтобы защитить семенной материал и прорастающее растение путем применения подходящего средства.

Борьба с фитопатогенными грибами путем обработки семенного материала растений известна уже давно и является предметом постоянного совершенствования. Однако при обработке семенного материала возникает ряд проблем, которые не всегда удается решить удовлетворительно. Так, следует стремиться к тому, чтобы развить способ защиты семенного материала и всходящих растений таким образом, который позволяет избежать дополнительного внесения средств защиты растений после посева или после всходов растений или, как минимум, отчетливо снизить. Далее желательно в такой степени оптимизировать количество применяемого биологически активного вещества, чтобы семенной материал и прорастающее растение были лучшим образом защищены от поражения фитопатогенными грибами, однако чтобы при этом использованное биологически активное вещество не повреждало растение. В особенности способы обработки семенного материала должны также вовлекать и внутренне присущие фунгицидные свойства трансгенных растений, для того чтобы достигнуть оптимальной защиты семенного материала и всходящего растения при минимальном расходе количества средства защиты растений.

В связи с этим данное изобретение также относится к способу защиты семенного материала и всходящих растений от поражения фитопатогенными грибами, при котором семенной материал обрабатывают средством согласно данному изобретению. Изобретение также относится к применению средства согласно данному изобретению для обработки семенного материала с целью защиты семенного материала

и всходящих растений от фитопатогенных грибов. Далее изобретение относится к семенному материалу, который для защиты от фитопатогенных грибов обработан средством согласно данному изобретению.

Борьбу с фитопатогенными грибами, которые поражают растения после всходов, проводят в первую очередь путем обработки средствами для защиты растений почвы и находящихся над поверхностью частей растений. В связи с возможностью влияния средств защиты растений на окружающую среду и здоровье людей и животных предпринимаются усилия по уменьшению количества наносимых биологически активных веществ.

Одно из преимуществ данного изобретения состоит в том, что в связи с особыми системными свойствами биологически активных веществ, соответственно, средств согласно данному изобретению обработка семенного материала этими биологически активными веществами, соответственно, средствами защищает от фитопатогенных грибов не только сам семенной материал, но и вырастающие из него растения после всходов. В связи с этим может отпадать необходимость непосредственной обработки культуры к моменту посева или на короткий промежуток времени после посева. Также является преимуществом то, что биологически активные вещества, соответственно, средства согласно данному изобретению можно применять и в семенном материале трансгенных культур, причем вырастающие из этого семенного материала растения способны экспримировать белок, который действует против вредителей. В результате обработки такого семенного материала биологически активными веществами, соответственно, средствами согласно данному изобретению можно как раз через экспрессию, например, инсектицидного белка бороться с определенными вредителями. При этом может неожиданно наблюдаться синергический эффект, который дополнительно увеличивает эффективность защиты от поражения вредителями.

Средства согласно данному изобретению пригодны для защиты семенного материала любых сортов растений, которые используют в сельском хозяйстве, в теплицах, в лесоводстве или в садоводстве и виноградарстве. В частности, при этом имеются в виду 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, оливковых деревьев, кокосовых орехов, какао, сахарного тростника, табака, овощных культур (таких как томаты, огурцы, лук и салат), газонных трав и декоративных растений (см. также ниже). Большое значение придается обработке семенного материала зерновых культур (таких как пшеница, ячмень, рожь, тритикале и овес), кукурузы и риса.

Как также описано ниже, обработка трансгенного семенного материала биологически активными веществами, соответственно, средствами согласно данному изобретению имеет особое 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 родов *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* или *Gliocladium*. Предпочтительно этот гетерологический ген происходит из *Bacillus* sp., причем генный продукт оказывает действие против кукурузной огневки (европейского точильщика корней) и/или западного кукурузного корневого червя. 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, т.е. 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, US 4245432, US 4808430, US 5876739, US 2003/0176428 A1, WO 2002/080675, WO 2002/028186.

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 и другие покровные массы для семенного материала, а также препараты в ультратонких объемах.

Эти препараты получают известным образом, смешивая биологически активные вещества 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.I. пигмент красный 112 и С.I. соль-вент красный 1.

В качестве смачивающих средств, которые могут содержаться в препаратах протравливающих средств, применяемых согласно данному изобретению, подходят все вещества, способствующие смачиванию и обычно используемые в препаратах агрохимических биологически активных веществ. Предпочтительно применяют алкилнафталин-сульфонаты, такие как диизопропил- или диизобутил-нафталинсульфонаты.

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 этиленоксид-пропиленоксида, простой алкил-фенолполигликолевый эфир, а также простой тристирилфенолполигликолевый эфир 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 противовспенивающие 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, применяемых согласно данному изобретению, подходят все вещества, используемые для такого рода целей в агрохимических средствах. В качестве примера можно привести дихлорофен и полуформаль 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 кремниевую 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 А1, А3 (= гиббереллиновая кислота), А4 и А7, более предпочтительно используют гиббереллиновую кислоту. Гиббереллины являются известными соединениями (см. R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", Bd. 2, Springer Verlag, 1970, p. 401-412).

Препараты протравливающих средств, применяемых согласно данному изобретению, могут применяться для обработки семенного материала различного вида, а также семенного материала трансгенных растений непосредственно или после предварительного разбавления водой. При этом возможно, что в результате взаимодействия с возникшими в результате экспрессии веществами будут проявляться дополнительные 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 сильное микробицидное действие и могут применяться для борьбы с нежелательными микроорганизмами, такими как грибы и бактерии при защите растений и при защите материалов.

Фунгициды могут применяться при защите растений для борьбы с плазмодиофоромицетами (Plas-

modiophoromyceten), оомицетами (Oomyceten), хитридиомицетами (Chytridiomyceten), цигомицетами (Zygomyceten), аскомицетами (Ascomyceten), базидиомицетами (Basi-diomyceten) и дейтеромицетами (Deuteromyceten).

Бактерициды могут применяться при защите растений для борьбы с псевдомоноадацеае (Pseudomonadaceae), ризобиацеае (Rhizobiaceae), энтеробактериацеае (Enterobacteriaceae), коринебактериацеае (Corynebacteriaceae) и стрептомицетацеае (Streptomycetaceae).

Фунгицидные средства согласно данному изобретению могут применяться 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 путем применения биологически активных веществ и 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 в концентрациях, необходимых для борьбы с болезнями растений, позволяет проводить обработку находящихся над поверхностью почвы частей растений, семенного и посадочного 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 генно-технологическими методами, или комбинацией этих методов, включая трансгенные растения и включая растения, защищенные правом по защите сортов, или не защищенные 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, благоприятной токсичности для теплокровных животных и хорошей переносимости окружающей средой пригодны для защиты растений и органов растений, для повышения урожайности, для улучшения качества продуктов урожая. Их можно предпочтительно применять в качестве средств защиты растений. Они эффективны по отношению к 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 яблони 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, газонные травы, зерновые культуры, такие как пшеница, рожь, рис, ячмень, овес, просо и тритикале), Poaceae sp. (например, сахарный тростник), 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 обработать согласно данному изобретению все растения и их части. В предпочтительном варианте изобретения обрабатывают виды и сорта растений, встречающиеся в диком виде или полученные обычными биологическими методами селекции, такими как скрещивание или фузия протопластов, а также их части. В другом предпочтительном варианте изобретения обрабатывают трансгенные растения и сорта растений, которые получены генно-технологическими способами при необходимости в комбинации с обычными способами (генетически модифицированные организмы) и их

части. Понятие "части", соответственно "части растений" или "растительные части" пояснено выше. Более предпочтительно обрабатывают согласно данному изобретению растения сортов растений, которые имеются в продаже или находятся в эксплуатации. Под сортами растений понимают растения с новыми свойствами ("Traits"), которые выращены путем обычной селекции, путем мутагенеза или с помощью рекомбинантной ДНК-техники. Это могут быть сорта, расы, биотипы и генотипы.

Способ обработки согласно данному изобретению можно применять при обработке генетически модифицированных организмов (GMOs), например, растений или семян. В случае генетически модифицированных растений (или трансгенных растений) имеются в виду растения, у которых гетерологический ген стабильно встроен в геном. Термин "гетерологический ген" означает в существенной мере ген, который произведен или собран в ансамбль вне растения и который в случае введения в геном ядра клетки, в геном хлоропласта или в геном митохондрии придает трансформированному растению новые или улучшенные агрономические или другие свойства, и, в частности, тем, что экспримирует представляющий интерес белок или полипептид или что он регулирует вниз или выключает другой ген, соответственно, другие гены, которые присутствуют в растении (например, с помощью антисенс-технологии, ко-супрессионной технологии или РНК-интерференционной технологии (РНКи-технологии)). Гетерологический ген, который находится в геноме, также обозначают как трансген. Трансген, который определяется своим определенным положением в геноме, называют трансформационным событием, соответственно трансгенным событием.

В зависимости от видов растений или сортов растений, их местонахождения и их условий роста (почвы, климат, вегетационный период, питание) обработка согласно данному изобретению может приводить к сверхаддитивным ("синергическим") эффектам. Так, например, возможны следующие эффекты, которые превышают собственно ожидаемые эффекты: уменьшенные расходные количества и/или расширенный спектр действия, и/или повышенная эффективность биологически активных веществ и препаратов, применяемых согласно данному изобретению, лучший рост растений, повышенная толерантность по отношению к высоким или низким температурам, повышенная толерантность к засушливости или к содержанию соли в воде или почве, повышенная эффективность цветения, облегчение уборки урожая, ускорение созревания, более высокие урожаи, более крупные плоды, большая высота растений, более интенсивный зеленый цвет листьев, более раннее цветение, более высокое качество и/или более высокая питательность продуктов урожая, более высокая концентрация сахара в плодах, лучшая сохраняемость при хранении на складе и/или перерабатываемость продуктов урожая.

При определенных расходных количествах комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению могут также оказывать укрепляющее действие на растения. Поэтому они подходят для мобилизации собственных защитных систем растений с целью защиты от нападения нежелательных фитопатогенных грибов, и/или микроорганизмов, и/или вирусов. Это может оказаться одной из причин повышенной эффективности комбинаций согласно данному изобретению, например, по отношению к грибам. Укрепляющие растения (индуцирующие устойчивость) вещества в данном контексте также начинают и такие вещества или комбинации веществ, которые способны так стимулировать защитную систему растений, что обработанные растения в том случае, когда их после обработки инокулируют нежелательными фитопатогенными грибами, проявляют существенную степень устойчивости по отношению к этим фитопатогенным грибам. В связи с этим вещества согласно данному изобретению применяют для защиты растений от поражения упомянутыми выше патогенами в течение определенного 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 растений биологически активными веществами.

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

Растения и сорта растений, которые также предпочтительно обрабатывают согласно данному изобретению, устойчивы по отношению к одному или нескольким биотическим стрессовым факторам, т.е. эти растения проявляют лучшую защиту по отношению к вредителям животного происхождения и к микробным вредителям, таким как нематоды, насекомые, клещи, фитопатогенные грибы, бактерии, вирусы и/или вириды.

К растениям и сортам растений, которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, относятся такие растения, которые устойчивы по отношению к одному или нескольким абиотическим стрессовым факторам. К абиотическим стрессовым факторам могут относиться, например, засуха, холод и жара, осмотический стресс, застойное затопление, повышенное содержание солей в почве, повышенное воздействие минералов, озоновые условия, сильные световые условия, ограниченная доступность азотных питательных веществ, ограниченная доступность фосфорных питательных веществ или избегание тени.

К растениям и сортам растений, которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, относятся такие растения, которые отличаются повышенными урожайными свойствами. По-

вышенная урожайность у этих растений может быть связана, например, с улучшенной физиологией растений, улучшенным ростом растений и улучшенным развитием растений, такими как эффективность использования воды, эффективность удерживания воды, улучшенное использование азота, повышенная ассимиляция углерода, улучшенный фотосинтез, увеличенная сила зародыша и ускоренное созревание. На урожайность далее может воздействовать улучшенная архитектура растения (при стрессовых и не стрессовых условиях), среди них раннее цветение, контроль за цветением для получения гибридного семенного материала, способность к росту зародыша и растения, размер растения, интернодиальное число и интернодиальное расстояние, рост корня, размер семян, размер плодов, размер стручка, число стручков или колосьев, число семян в стручке или колосе, масса семян, усиленное заполнение семян, уменьшенное выпадение семян, уменьшенное лопание стручков, а также устойчивость. К другим признакам урожайности относятся состав, такой как содержание углеводов, содержание белка, содержание масла и состав масла, питательность, уменьшение содержания ненужных для питания веществ, улучшенная перерабатываемость и улучшенная сохраняемость при хранении на складе.

Растения, которые могут быть обработаны согласно данному изобретению, представляют собой гибридные растения, которые уже экспримируют свойства гетерозиса, соответственно, гибридного эффекта, что вообще приводит к более высокому урожаю, более высокому росту, лучшему здоровью и лучшей устойчивости по отношению к биотическим и абиотическим стрессовым факторам. Такие растения производят типичным образом в результате того, что скрещивают выведенную путем инцухта родительскую линию со стерильной пылью (женский партнер при скрещивании) с другой выведенной путем инцухта родительской линией с фертильной пылью (мужской партнер при скрещивании). Гибридный семенной материал получают типичным образом в виде урожая от растений со стерильной пылью и продают предприятию, занимающемуся размножением. Растения со стерильной пылью могут иногда быть произведены (например, в случае кукурузы) путем удаления метелок, например, путем удаления мужских половых органов (соответственно, мужских соцветий); однако является более обычным, когда стерильность пыльцы опирается на генетическое детерминирование в геноме растения. В этом случае, в частности в том случае, когда имеется в виду в качестве желательного продукта семена, которые хотят снять в виде урожая гибридных растений, обычно необходимо убедиться, что полностью восстановлена фертильность пыльцы в гибридных растениях. Это может быть достигнуто в результате того, что существует гарантия того, что мужские партнеры при скрещивании содержат гены, восстанавливающие фертильность, которые способны восстановить фертильность пыльцы гибридных растений, которые содержат генетические детерминанты, отвечающие за фертильность пыльцы. Генетические детерминанты для стерильности пыльцы могут быть локализованы в цитоплазме. Примеры цитоплазмной стерильности пыльцы (CMS) были описаны, например, для Brassica-видов. Генетические детерминанты стерильности пыльцы могут однако также быть локализованы в геноме ядра клетки. Растения со стерильной пылью могут быть также получены способами растительной биотехнологии, такими как генная техника. Особенно благоприятный способ получения растений со стерильной пылью описан в WO 89/10396, причем например, экспримируется одна рибонуклеаза, такая как барназа селектив (*Barnase selektiv*) в покровных клетках опылительных листьев. Фертильность в этом случае может быть восстановлена путем экспрессии ингибитора рибонуклеазы, такого как барстар (*Barstar*) в покровных клетках.

Растения и сорта растений (которые получают способами биотехнологии растений, такими как генная технология), которые могут быть обработаны согласно данному изобретению, представляют собой толерантные к гербицидам растения, т.е. растения, которые выращены толерантными по отношению к одному или нескольким предусмотренным гербицидам. Такие растения могут быть получены или путем генетической трансформации, или путем селекции растений, которые содержат мутацию, которая обеспечивает такую толерантность к гербицидам.

К устойчивым к гербицидам растениям относятся, например, устойчивые к глифосату растения, т.е. растения, которые выращены толерантными по отношению к гербициду глифосату или к его солям. Растения могут быть сделаны толерантными к глифосату различным образом. Так, например, можно создать растения, толерантные к глифосату, путем трансформации растения геном, который кодирует энзим 5-энолпирувилшикимат-3-фосфатсинтазы (EPSPS). Примером таких EPSPS-генов являются *AgoA*-ген (мутант CT7) бактерии *Salmonella typhimurium*, CP4-ген бактерии *Agrobacterium sp.*, гены, которые кодируют одну EPSPS из петунии, одну EPSPS из томатов или одну EPSPS из элеусина. Могут также иметься в виду и мутированные EPSPS. Толерантные к глифосату растения можно также получать в результате того, что экспримируют ген, который кодирует энзим глифосат-оксиредуктазы. Толерантные к глифосату растения можно также получать в результате того, что экспримируют ген, который кодирует энзим глифосат-ацетилтрансферазы. Толерантные к глифосату растения можно также получать в результате того, что проводят селекцию растений, которые содержат естественно встречающиеся мутации упомянутых выше генов.

К другим устойчивым к гербицидам растениям относятся, например, растения, которые созданы толерантными по отношению к гербицидам, ингибирующим энзим глутаминсинтазы, таким как биалафос, фосфинотрицин или глуфосинат. Такие растения могут быть получены в результате того, что экспримируют энзим, который обезвреживает гербицид, или мутанта энзима глутаминсинтазы, который устойчив

по отношению к ингибированию. Таким эффективным обезвреживающим энзимом является, например, энзим, который кодирует фосфинотрицин-ацетилтрансферазу (такой как, например, бар- или пат-белок из *Streptomyces*-видов). Растения, которые экспримируют экзогенную фосфинотрицин-ацетилтрансферазу, описаны.

К другим толерантным к гербицидам растениям также относятся растения, которые созданы толерантными к гербицидам, ингибирующим энзим гидроксифенилпируватдиоксигеназы (HPPD). В случае гидроксифенилпируватдиоксигеназы имеется в виду энзим, который катализирует реакцию, при которой пара-гидроксифенилпируват (HPP) превращается в гомогентисат. Растения, которые толерантны по отношению к HPPD-ингибиторам, могут быть трансформированы геном, который кодирует естественно встречающийся устойчивый HPPD-энзим, или ген, который кодирует мутированный HPPD-энзим. Толерантность по отношению к HPPD-ингибиторам может быть также достигнута в результате того, что растения трансформируют генами, которые кодируют определенные энзимы, которые создают возможность образования гомогентисата, несмотря на ингибирование естественного HPPD-энзима с помощью HPPD-ингибитора.

Толерантность растений по отношению к HPPD-ингибиторам можно также улучшить в результате того, что растения дополнительно к гену, который кодирует энзим, толерантный к HPPD, трансформируют геном, который кодирует энзим префенатдегидрогеназы.

Другие устойчивые к гербицидам растения представляют собой растения, которые созданы толерантными по отношению к ацетолактатсинтазы (ALS)-ингибиторам. К известным ALS-ингибиторам относятся, например, сульфонилмочевина, имидазолинон, триазоло-пиримидины, пиримидинилокси(тио)бензоаты и/или сульфониламино-карбонилтриазолиноновые гербициды. Известно, что различные мутации в энзиме ALS (также известном как ацетогидроксикислоты-синтаза, AHAS) придают толерантность по отношению к различным гербицидам, соответственно, группам гербицидов. Производство растений, толерантных к сульфонилмочевине, и растений, толерантных к имидазолинону, описано в международном патенте WO 1996/033270. Другие растения, толерантные к сульфонилмочевине и имидазолинону, описаны также, например, в WO 2007/024782.

Другие растения, которые толерантны к имидазолинону и/или сульфонилмочевине, можно получить путем индуцированного мутагенеза, селекции в клеточных структурах в присутствии гербицида или путем селекции мутантов.

Растения или сорта растений (которые получены способами биотехнологии растений, такими как генная технология), которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, являются устойчивые к насекомым трансгенные растения, т.е. растения, которые созданы устойчивыми от поражения определенными целевыми насекомыми. Такие растения могут быть созданы путем генетической трансформации или селекции растений, которые содержат мутацию, придающую такую устойчивость к насекомым.

Понятие "устойчивое к насекомым трансгенное растение" охватывает в связи с данными обстоятельствами любое растение, которое содержит как минимум один трансген, который охватывает кодирующую последовательность, вызывающую кодирование следующего:

1) инсектицидного кристаллического белка из *Bacillus thuringiensis* или его инсектицидной части, таких как инсектицидные кристаллические белки, которые описаны и составлены по интернетовскому адресу: http://www.lifesci.Sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/, или их инсектицидные части, например, белки из Cry-классов белков Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Ae или Cry3Bb или их инсектицидные части; или

2) кристаллического белка из *Bacillus thuringiensis* или его части, который в присутствии второго, другого кристаллического белка в качестве *Bacillus thuringiensis* или его части действует инсектицидно, как бинарный токсин, который состоит из кристаллических белков Cry34 и Cry35; или

3) инсектицидного гибридного белка, который состоит из частей двух различных инсектицидных кристаллических белков из *Bacillus thuringiensis*, таких как, например, гибрид из белков 1) выше или гибрид из белков 2) выше, например, белок Cry1A.105, который получают из кукурузы-события MON89034 (WO 2007/027777); или

4) белка согласно одному из пунктов 1)-3) выше, причем некоторые, в особенности 1-10, аминокислоты замещены на другую аминокислоту, для того чтобы достигнуть более высокой инсектицидной эффективности по отношению к целевому виду насекомых и/или для того чтобы расширить спектр охватываемых целевых видов насекомых, и/или в связи с изменениями, которые были индуцированы в кодирующей ДНК во время клонирования или трансформации, такие как белок Cry3Bb1 в кукурузы-событии MON863 или MON88017 или белок Cry3A в кукурузы-событии MIR 604; или

5) инсектицидного выделенного белка из *Bacillus thuringiensis* или *Bacillus cereus*, или инсектицидной части его, такого как вегетативно действующие инсектицидные белки (вегетативные инсектицидные белки, VIP), которые приведены по интернетовскому адресу http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, например, белки из класса белков VIP3Aa; или

6) выделенного белка из *Bacillus thuringiensis* или *Bacillus cereus*, который в присутствии второго

выделенного белка из *Bacillus thuringiensis* или *B. cereus* действует инсектицидно, как бинарный токсин, который состоит из белков VIP1A и VIP2A; или

7) инсектицидного гибридного белка, который охватывает части различных выделенных белков из *Bacillus thuringiensis* или *Bacillus cereus*, такого как гибрид белков 1) выше или гибрид белков 2) выше; или

8) белка по одному из пунктов 1)-3) выше, в котором некоторые, в особенности 1 - 10, аминокислоты замещены на другую аминокислоту, для того чтобы достигнуть более высокой инсектицидной эффективности по отношению к целевому виду насекомых и/или для того чтобы расширить спектр охватываемых целевых видов насекомых, и/или в связи с изменениями, которые были введены в кодирующую ДНК во время клонирования или трансформации (причем кодирование для инсектицидного белка сохраняется), такого как белок VIP3Aa в хлопчатника-события COT 102.

Конечно, к устойчивым к насекомым трансгенным растениям в связи с изложенным относятся также любые растения, которые охватывают комбинацию генов, кодирующих белки одного из приведенных выше классов 1-8. В одном варианте изобретения устойчивое к инсектицидам растение содержит более чем один трансген, который кодирует белок одного из приведенных выше классов 1-8, для того чтобы расширить спектр охваченных целевых насекомых, когда применяют различные белки, которые нацелены на различные виды целевых насекомых, или для того чтобы замедлить развитие устойчивости насекомых по отношению к растениям в результате того, что используют различные белки, которые действуют инсектицидно на тот же целевой вид насекомых, однако имеют различные механизмы действия, такие как связывание с различными местами связывания рецептора в насекомом.

Растения и сорта растений (которые получены способами биотехнологии растений, такими как генная технология), которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, толерантны по отношению к абиотическим стрессовым факторам. Такие растения могут быть получены путем генетической трансформации или селекции растений, которые содержат одну мутацию, создающую такую устойчивость к стрессу. К особенно полезным растениям, обладающим толерантностью к стрессам, относятся следующие:

а) растения, содержащие один трансген, который способен уменьшить экспрессию и/или активность гена для поли(ADP-рибозы)полимеразы (PARP) в клетках растений или в растениях;

б) растения, которые содержат трансген, создающий толерантность к стрессу, который способен уменьшить экспрессию и/или активность гена растений и растительных клеток, кодирующего PARP;

с) растения, которые содержат трансген, создающий толерантность к стрессу, который кодирует в растениях функциональный энзим пути никотинамидадениндинуклеотид-сальваж-биосинтеза, среди них никотинамидазу, никотинатфосфорибозилтрансферазу, никотиновой-кислотымононуклеотидаденилтрансферазу, никотинамидаденин-динуклеотидсинтазу или никотинамидфосфорибозилтрансферазу.

Растения и сорта растений (которые получены способами биотехнологии растений, такими как генная технология), которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, показывают измененное количество, качество и/или сохраняемость на складе продуктов урожая и/или измененные свойства определенных компонентов продукта урожая, такие как, например:

1) Трансгенные растения, синтезирующие модифицированный крахмал, который относительно своих физико-химических свойств, особенно содержания амилозы или соотношения амилоза/амилопектин, степени разветвления, средней длины цепи, распределения боковых цепей, вязкостного поведения, прочности геля, размера зерен крахмала и/или морфологии зерен крахмала имеет изменения по сравнению с синтезированным крахмалом в клетках дикого типа растений или в растениях дикого типа, так что этот модифицированный крахмал лучше подходит для определенных применений.

2) Трансгенные растения, которые синтезируют не крахмальные углеводные полимеры, или не крахмальные углеводные полимеры, свойства которых по сравнению с дикими типами растений изменены без генетической модификации. Примерами являются растения, которые производят полифруктозу, в частности инулинового и леванового типа, растения, которые производят альфа-1,4-глюканы, растения, которые производят альфа-1,6-разветвленные альфа-1,4-глюканы, и растения, которые производят алтернан.

3) Трансгенные растения, которые продуцируют хиалуронан.

Растения или сорта растений (которые получены способами биотехнологии растений, такими как генная технология), которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, представляют собой такие растения, как растения хлопчатника с измененными свойствами волокон. Такие растения получают путем генетической трансформации или путем селекции растений, которые содержат мутацию, придающую такие измененные свойства волокон; к ним относятся:

а) растения, такие как растения хлопчатника, которые содержат измененные формы генов целлюлозасинтазы;

б) растения, такие как растения хлопчатника, которые содержат измененную форму *rsw2*- или *rsw3*-гомологических нуклеиновых кислот;

с) растения, такие как растения хлопчатника с повышенной экспрессией сахарозафосфатсинтазы;

- d) растения, такие как растения хлопчатника с повышенной экспрессией сахарозасинтазы;
- e) растения, такие как растения хлопчатника, у которых изменен момент времени управления пропускания плазмодесмов на основе клеток волокон, например, в результате регулирования вниз волоконно-селективной β -1, 3-глюканазы;
- f) растения, такие как растения хлопчатника с волокнами с измененной реактивностью, например, в результате экспрессии гена N-ацетилглюкозаминтрансферазы, среди них также podC, и генов хитинсинтазы.

Растения и сорта растений (которые получены способами биотехнологии растений, такими как генная техника), которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, являются такие растения, как рапс или родственные Brassica-растения с измененными свойствами состава масла. Такие растения могут быть получены путем генетической трансформации или путем селекции растений, которые содержат мутацию, придающую такие измененные свойства масла, к ним относятся:

- a) растения, такие как растения рапса, которые производят масло с высоким содержанием олеиновой кислоты;
- b) растения, такие как растения рапса, которые производят масло с низким содержанием линоленовой кислоты;
- c) растения, такие как растения рапса, которые производят масло с низким содержанием насыщенных жирных кислот.

Особенно полезными трансгенными растениями, которые могут быть обработаны согласно данному изобретению, являются растения, содержащие один или несколько генов, которые кодируют один или несколько токсинов, являются трансгенные растения, которые продаются под следующими 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 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 (традиционно выращиваемым на толерантность к гербицидам растениям), которые следует упомянуть, относятся продаваемые под названием Clearfield® сорта (например, кукуруза).

Особенно полезными трансгенными растениями, которые могут быть обработаны согласно данному изобретению, являются растения, которые содержат события трансформации или комбинацию событий трансформации и которые приведены, например, в базах данных различных национальных или региональных ведомств (смотри, 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 и насекомые.

Кроме того, соединения согласно данному изобретению могут применяться сами по себе или в комбинации с другими биологически активными веществами в качестве средств против обрастания.

Под техническими материалами следует понимать в данной связи неживые материалы, которые приготовлены для применения в технике. Например, техническими материалами, которые должны быть защищены от грибкового изменения или разрушения, могут быть клеящие вещества, глины, бумага и картон, текстиль, ковры, 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 и зданий, например, контуры водяного охлаждения, охлаждающие и нагревательные системы и вентиляционные и кондиционирующие системы, которым может быть причинен ущерб за счет размножения микроорганизмов. В рамках данного изобретения следует назвать в качестве технических материалов предпочтительно клеящие вещества, глины, 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. Кроме того, соединения согласно данному изобретению могут применяться для защиты предметов от обрастания, в частности, корпусов кораблей, сит, сетей, строений, причалов и сигнальных установок, которые находятся в контакте 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, мачты линий электроснабжения и ограды, или в виде готовых продуктов, таких как мебель. К товарам, подлежащим длительному хранению, животного происхождения относятся, например, шкуры животных, кожа, шубы и шерсть (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 заболеваний, 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 (*Podosphaera*), такие как, например, *Podosphaera 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 гимноспорангий (*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 уромйцес (*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 фитопфтора (*Phytophthora*), такие как, например, *Phytophthora infestans*; виды рода плазмопара (*Plasmopara*), такие как, например, *Plasmopara viticola*; 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* (конидиальная форма: Дрекслера, син: гельминтоспориум); виды рода коллетотрихум (*Colletotrichum*), такие как, например, *Colletotrichum lindemuthianum*; виды рода циклоконий (*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 cingulata*; виды рода гуигнардия (*Guignardia*), такие как, например, *Guignardia bidwelli*; виды рода лептосфера (*Leptosphaeria*), такие как, например, *Leptosphaeria maculans*; виды рода магнапорте (*Magnaporthe*), такие как, например, *Magnaporthe grisea*; виды рода микродохий (*Microdochium*), такие как, например, *Microdochium nivale*; виды рода микосферелла (*Mycosphaerella*), такие как, например, *Mycosphaerella graminicola* и *M. fijiensis*; виды рода феосфера (*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 кортиций (*Corticium*), такие как, например, *Corticium graminearum*; виды рода фузариум (*Fusarium*), такие как, например, *Fusarium oxysporum*; виды рода гаеуманномйцес (*Gaeumannomyces*), такие как, например, *Gaeumannomyces graminis*; виды рода ризоктония (*Rhizoctonia*), такие как, например, *Rhizoctonia solani*; виды рода тапезия (*Tapesia*), такие как, например, *Tapesia aciformis*; 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 головневными грибами, такими как, например, виды рода сфаселотека (*Sphaelotheca*), такие

как, например, *Sphacelotheca reiliana*; виды рода тиллетия (*Tilletia*), такие как, например, *Tilletia caries*, *T. controversa*; виды рода уроцистис (*Urocystis*), такие как, например, *Urocystis occulta*; 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 cactorum*; 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 монилия (*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 алтернэрия (*Alternaria spec. atrans tenuissima*), антракнозе (*Anthracoze*) (*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 trisporea* (син.)), пятна на листьях, вызываемые видом рода дактилиофора (*Dactuliophora glycines*), пушистая плесень, вызываемая видом рода пероноспора (*Pergonospora 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 (*Pyrenochaeta 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 (*Sphaceloma glycines*), увядание листьев, вызываемое видом рода стемфилий (*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*), углеводное 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 (*Neocosmopora 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 фитофтора (*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 тиелавиоп-

сис (*Thielaviopsis basicola*).

В качестве микроорганизмов, которые могут вызвать разрушение или изменение технических материалов, следует назвать грибы.

Предпочтительно биологически активные вещества согласно данному изобретению действуют против грибов, в частности, плесневых грибов, грибов, окрашивающих древесину, и грибов, разрушающих древесину базидиомицетов (*Basidiomyceten*). В качестве примера следует назвать следующие виды родов: альтернария (*Alternaria*), такие как *Alternaria tenuis*; аспергиллус (*Aspergillus*), такие как *Aspergillus niger*; хаетомиум (*Chaetomium*), такие как *Chaetomium globosum*; кониофора (*Coniophora*), такие как *Coniophora puetana*; лентинус (*Lentinus*), такие как *Lentinus tigrinus*; пенициллиум (*Penicillium*), такие как *Penicillium glaucum*; полипорус (*Polyporus*), такие как *Polyporus versicolor*; ауреобазидиум (*Aureobasidium*), такие как *Aureobasidium pullulans*; склерофома (*Sclerophoma*), такие как *Sclerophoma pityophila*; триходерма (*Trichoderma*), такие как *Trichoderma viride*.

Наряду с этим, биологически активные вещества согласно данному изобретению проявляют также очень хорошие антимикотические действия. Они обладают очень широким антимикотическим спектром действия, в особенности против дерматофитов и побеговых грибов, плесневых и дифазных грибов (например, против видов рода кандиды (*Candida*), таких как *Candida albicans*, *Candida glabrata*), а также *Epidermophyton floccosum*, видов рода аспергиллус (*Aspergillus*), таких как *Aspergillus niger* и *Aspergillus fumigatus*, видов рода трихофитон (*Trichophyton*), таких как *Trichophyton mentagrophytes*, видов рода микроспорон (*Microsporon*), таких как *Microsporon canis* и *audouinii*. Перечисление этих грибов ни в коем случае не является ограничением охватываемого микотического спектра, а имеет только поясняющий характер.

В связи с этим биологически активные вещества согласно данному изобретению могут применяться как в медицинских, так и в не медицинских целях.

При применении биологически активных веществ согласно данному изобретению в качестве фунгицидов расходные количества в зависимости от способа применения могут варьироваться в широком интервале. Расходное количество биологически активных веществ согласно данному изобретению составляет

при обработке частей растений, например, листьев: от 0,1 до 10 000 г/га, предпочтительно от 10 до 1000 г/га, более предпочтительно от 50 до 300 г/га (при применении путем поливания или капания расходное количество может быть даже уменьшено, прежде всего в том случае, когда применяют инертные субстраты, такие как минеральная 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, еще более 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 и не являются ограничивающими по смыслу изобретения.

Биологически активные вещества, соответственно, средства согласно данному изобретению могут таким образом применяться для защиты растений в течение определенного промежутка времени после обработки от поражения названными возбудителями вреда. Интервал времени, в течение которого создается защита, простирается, как правило, от 1 до 28 дней, предпочтительно от 1 до 14 дней, более предпочтительно от 1 до 10 дней, еще более предпочтительно от 1 до 7 дней после обработки растений биологически активными веществами, соответственно, сохраняет свое действие в течение вплоть до 200 дней после обработки семян.

Кроме того, в результате обработки согласно данному изобретению можно уменьшить содержание микотоксинов в продуктах урожая и в 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, диацетоксискирпенол (DAS), беауверин, энниатин, фузаропротрофериин, фузаренол, охратоксин, патулин, алколоиды 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.

Соединения согласно данному изобретению при необходимости в определенных концентрациях, соответственно, расходных количествах могут применяться в качестве гербицидов, защитных веществ, регуляторов роста растений или средств для улучшения свойств растений, или в качестве микробицидов, например, в качестве фунгицидов, антимикотиков, бактерицидов, вирицидов (включая средства против вирицидов) или в качестве против MLO (подобные микоплазме организмы) и против RLO (подобные *Rickettsia* организмы). Их можно также применять в качестве промежуточных или исходных продуктов для синтеза других биологически активных веществ.

Соединения согласно данному изобретению внедряются в метаболизм растений и в связи с этим могут применяться в качестве регуляторов роста растений.

Регуляторы роста растений могут проявлять различные воздействия на растения. Воздействия веществ зависят в существенной мере от момента времени применения по отношению к стадии развития растения, а также от количества биологически активного вещества, нанесенного на растения и на их окружение, и от вида применения. В каждом случае регуляторы роста должны воздействовать на культурные растения определенным желательным образом. Регулирующие рост растений вещества могут применяться, например, для торможения вегетативного роста растений. Такого рода торможение роста представляет среди прочего хозяйственный интерес в случае трав, так как это позволяет уменьшить частоту покосов травы в декоративных парках, в парках и спортивных сооружениях, на обочинах дорог, на летних полях аэродромов или на садовых плантациях. Имеет значение также торможение роста богатых ботвой травянистых растений и древесных растений на обочинах дорог и вблизи трубопроводов или под высоковольтными линиями передач, или вообще в местах, в которых быстрый прирост растений не желателен. Также важно применение регуляторов роста для торможения роста в высоту растений зерновых культур. Так как это позволяет снизить опасность подламывания ("полегания") растений перед уборкой урожая или полностью устранить его. Кроме того, регуляторы роста растений могут вызывать у растений зерновых культур упрочнение стеблей, которое также противодействует полеганию. Применение регуляторов роста растений для укорочения стеблей и упрочнения стеблей создает возможность для внесения большего количества удобрений, для того чтобы повысить урожайность, избегая при этом опасности полегания растений зерновых культур.

Торможение вегетативного роста позволяет повысить плотность посадки у многих культурных растений, так что может быть достигнуто большое число приносящих урожай растений на той же площади. Преимущество достигнутых таким образом меньших растений состоит также в том, что в результате облегчается обработка культуры и сбор урожая.

Торможение вегетативного роста растений может и потому приводить к повышению урожайности, что питательные вещества и ассимиляты в большей мере подаются к цветам и для образования продукта урожая по сравнению с вегетативными частями растений.

С помощью регуляторов роста растений часто удается также достигнуть ускорения вегетативного роста. Это приносит большую пользу в том случае, когда урожай получают в виде вегетативных частей растений. Ускорение вегетативного роста может, однако, также одновременно приводить к ускорению генеративного роста, в результате которого образуются ассимиляты, так что образуются больше плодов или большие плоды.

Повышение урожайности в некоторых случаях может быть достигнуто путем внедрения в растительный обмен веществ, причем изменения вегетативного роста при этом могут быть не заметны. Далее регуляторы роста могут вызвать изменения состава веществ в растениях, что приводит, в свою очередь, к улучшению качества продуктов урожая. Так, например, возможно повышение содержания сахара в сахарной свекле, сахарном тростнике, ананасах, а также в цитрусовых фруктах, или повышение содержания белка в сое или в зерновых культурах. Также возможно, например, затормозить разложение желательных содержащихся веществ, таких как, например, сахар в сахарной свекле и в сахарном тростнике, с помощью регуляторов роста перед сбором или после сбора урожая. Кроме того, удается оказывать положительное воздействие на производство или на отток вторичных веществ, содержащихся в растениях. В качестве примера можно назвать стимулирование латексного потока у каучуковых деревьев.

Под влиянием регуляторов роста растений может происходить образование партенокарпных фруктов. Далее может быть оказано влияние на поколение соцветий. Может быть также создана стерильность пыльцы, что играет большую роль при селекции и получении гибридного семенного материала.

В результате применения регуляторов роста растений удается управлять разветвлением растений. С одной стороны, в результате нарушения апикальной (верхушечной) доминантности можно способствовать развитию боковых побегов, что может оказаться особенно желательным при выращивании декоративных растений, а также в связи с торможением роста растений. Этот эффект представляет большой интерес при выращивании табака и помидоров. Под влиянием регуляторов роста растений можно так регулировать состояние листьев растений, что потеря растениями листьев достигается в заданный момент времени. Такого рода потеря растениями листьев играет большую роль при механической уборке урожая хлопка, но и в других культурах, таких как, например, виноград, приводит к облегчению сбора урожая. Удаление листьев у растений можно также предпринимать для уменьшения транспирации расады растений перед их пересадкой.

Регуляторы роста растений позволяют также регулировать опадание фруктов. С одной стороны, можно воспрепятствовать преждевременному опаданию. Однако, с другой стороны, можно также способствовать опаданию фруктов или даже соцветий до желательной массы ("разреживание"), для того чтобы сломить чередование. Под чередованием понимаются эндогенно обусловленную особенность некоторых фруктовых деревьев иметь год от года разные (чередующиеся) урожаи. Наконец, существует возможность с помощью регуляторов роста к моменту уборки уменьшить прочность связи, удерживающей фрукты на дереве, для создания возможности для механической уборки урожая или для облегчения руч-

ной уборки урожая.

С помощью регуляторов роста растений удастся далее достигнуть ускорения или замедления созревания продуктов урожая перед сбором урожая и после сбора урожая. Это представляет собой особенное преимущество в связи с тем, что позволяет оптимально приспособиться к потребностям рынка. Далее регуляторы роста растений позволяют в некоторых случаях улучшить окраску фруктов. Кроме того, регуляторы роста позволяют достигнуть сокращения промежутка времени, в течение которого происходит созревание. Это позволяет создать предпосылки для того чтобы, например, полную механическую или ручную уборку урожая табака, томатов или кофе можно было осуществить в одном рабочем процессе.

С помощью регуляторов роста растений можно далее оказать влияние на состояние покоя семян или бутонов растений, так что растения, такие как, например, ананас или декоративные растения, в парках и садах в одно время прорастают, выгоняют побеги или цветут, к которому они в нормальных условиях не проявляют готовности. Замедление выгона бутонов или прорастания семян с помощью регуляторов роста растений может оказаться желательным в областях, в которых имеется опасность заморозков, для того чтобы избежать повреждений при поздних заморозках.

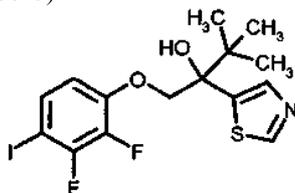
Наконец регуляторы роста растений могут индуцировать устойчивость растений по отношению к морозу, сухости или высокому содержанию солей в почве. Это создает возможность культивирования растений в областях, которые для этого нормальным образом не подходят.

Приведенные растения можно особенно предпочтительно обработать соединениями общей формулы (I) согласно данному изобретению и средствами согласно данному изобретению. Приведенные выше для биологически активных веществ, соответственно, средств предпочтительные области справедливы и для обработки этих растений. Более предпочтительна обработка растений специально приведенными в этом тексте соединениями, соответственно, средствами.

Изобретение поясняется следующими примерами. Однако, изобретение не ограничивается этими примерами.

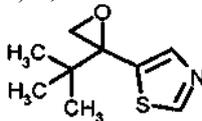
Примеры получения

Получение соединения № 1 (способ С)



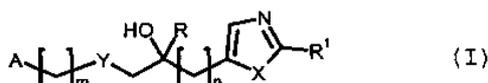
К 0,86 г (3,4 ммоль) 2,3-дифтор-4-йодфенола, растворенного в 10 мл N,N-диметилформамида, добавляют при комнатной температуре в атмосфере аргона 0,13 г (60%, 3,4 ммоль) гидрида натрия и реакционную смесь перемешивают в течение 1 ч при комнатной температуре. Затем добавляют 0,56 г (3,0 ммоль) 5-(2-трет-бутилоксиран-2-ил)-1,3-тиазола и реакционную смесь перемешивают в течение 12 ч при температуре 100°C. Охлаждают до комнатной температуры и отгоняют растворитель при пониженном давлении, а к остатку добавляют насыщенный водный раствор хлористого натрия, а также этилацетат. Отделяют органическую фазу, сушат над сульфатом натрия, фильтруют и отгоняют растворитель. Затем сырой продукт очищают на хроматографической колонке (циклогексан/этиловый эфир уксусной кислоты 3:1). Получают 0,04 г (3%) желаемого продукта.

Получение 5-(2-трет-бутилоксиран-2-ил)-1,3-тиазола



Получение осуществляют аналогично способу, описанному в EP-A 0409418.

Таблица 1



№	X	Y	m	n	R	R ¹	A	Физические данные
1	S	O	0	0	tBu	H	2,3-дифтор-4-йодфенил	logP 3,76 ^[a] ; [M] ⁺ = 440.
2	S	O	0	0	MCP	H	4-йод-2,6-диметилфенил	¹ H ЯМР: δ (400 МГц, ДМСО-d ₆) = 0,1-0,18 (m, 1H), 0,28-0,38 (m, 1H), 0,88-1,05 (m, 2H), 0,98 (s, 3H), 2,19 (s, 6H), 3,98 (d, 1H), 4,17 (d, 1H), 5,72 (s, 1H), 7,38 (s, 2H), 7,91 (s, 1H), 8,99 (s, 1H) млн. долей.
3	S	O	0	0	MCP	H	4-йод-3,5-диметилфенил	¹ H ЯМР: δ (400 МГц, ДМСО-d ₆) = 0,1-0,18 (m, 1H), 0,28-0,36 (m, 1H), 0,85-1,05 (m, 2H), 0,96 (s, 3H), 2,38 (s, 6H), 4,20 (d, 1H), 4,39 (d, 1H), 5,65 (s, 1H), 6,88 (s, 2H), 7,83 (s, 2H), 8,97 (s, 1H) млн. долей.
4	S	O	0	0	MCP	H	4-бром-2,5-дифторфенил	¹ H ЯМР: δ (400 МГц, ДМСО-d ₆) = 0,1-0,18 (m, 1H), 0,28-0,35 (m, 1H), 0,85-0,95 (m, 1H), 0,95 (s, 3H), 0,97-1,05 (m, 1H), 4,41 (d, 1H), 4,49 (d, 1H), 5,73 (s, 1), 7,54 (dd, 1H), 7,68 (dd, 1H), 7,88 (s, 1H), 8,99 (s, 1H) млн. долей.
5	S	O	0	0	MCP	H	4-йод-2,5-диметилфенил	logP 4,38 ^[a] ; [M] ⁺ = 430.
6	S	O	0	0	MCP	H	4-бром-2,6-дифторфенил	logP 3,51 ^[a] ; [M] ⁺ = 390, 392
7	S	O	0	0	MCP	H	4-бром-2,3-дифторфенил	logP 3,35 ^[a] ; [M] ⁺ = 390, 392
8	S	O	0	0	MCP	H	4-бром-2,6-диметилфенил	¹ H ЯМР: δ (400 МГц, ДМСО-d ₆) = 0,1-0,15 (m, 1H), 0,30-0,35 (m, 1H), 0,89-0,94 (m, 1H), 0,97 (s, 3H), 0,98-1,04 (m, 1H), 2,22 (s, 6H), 3,99 (d, 1H), 4,19 (d, 1H), 5,79 (s, 1H), 7,22 (s, 2H), 7,91 (s, 1H), 8,99 (s, 1H) млн. долей.
9	S	O	0	0	MCP	H	4-бром-3,5-диметилфенил	logP 4,14 ^[a] ; [M] ⁺ = 382, 384
10	S	O	0	0	MCP	H	4-бром-3,5-дифторфенил	logP 3,47 ^[a]
11	S	O	0	0	tBu	H	2,6-диметил-4-[(трифторметил)сульфанил]-фенил	logP 4,95 ^[a]

tBu = трет-бутил, MCP = 1-метилциклопропил.

Измерение значений logP проводилось согласно Инструкции EEC Directive 79/831 Annex V.A8 с помощью ЖХВР (жидкостной хроматографии высокого разрешения) на колонках с обратной фазой (C 18), с помощью следующих методов:

[a] определение с помощью ЖХ-МС (жидкостной хроматографии-масс-спектрометрии в кислой области проводилось при pH 2,7 с 0,1-процентной водной муравьиной кислотой и ацетонитрилом (содержал 0,1% муравьиной кислоты) в качестве элюентов с линейным градиентом от 10% ацетонитрила до 95% ацетонитрила.

Дополнительные данные ЯМР-спектров для выбранных примеров.

Данные ^1H -ЯМР-спектров, которые приведены ниже, для выбранных примеров приведены в виде списка пиков ^1H -ЯМР-спектра. Для каждого пика сигнала вначале указывается δ -значение в млн. долях, а затем приводится интенсивность сигнала в скобках, отделенная пробелом. Пары чисел δ -значение-интенсивность сигнала для различных пиков сигналов разделены точкой с запятой. В связи с этим список пиков одного примера имеет вид:

δ_1 (интенсивность₁); δ_2 (интенсивность₂); ...; δ_i (интенсивность_i); ...; δ_n (интенсивность_n).

Растворитель, в котором записывался ЯМР-спектр, заключен в квадратные скобки после номера примера и приведен перед списком пиков ЯМР-спектра. Детальное описание представления в патентах данных ЯМР-спектров в виде списка пиков приведено в публикации "Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications" (см. Research Disclosure Database Number 564025, 2011, 16 Marz 2011 или <http://www.rdelectronic.co.uk/rd/free/RD564025.pdf>).

Пример 10	[DMSO-D ₆]	8,9788 (3,80); 8,9775 (3,67); 7,8505 (4,51); 7,8490 (4,39); 7,4520 (3,16); 7,4303 (3,37); 6,7182 (2,50); 6,7114 (2,74); 6,6122 (1,66); 6,6054 (1,47); 6,5904 (1,57); 6,5836 (1,41); 5,6779 (4,88); 4,4771 (1,87); 4,4522 (2,27); 4,2521 (2,21); 4,2272 (1,85); 3,8394 (16,00); 3,3091 (73,39); 2,5226 (0,56); 2,5093 (6,46); 2,5049 (11,90); 2,5004 (15,51); 2,4960 (10,91); 2,4916 (5,34); 2,0849 (0,53); 1,0189 (0,38); 1,0055 (0,55); 0,9952 (0,98); 0,9808 (1,05); 0,9656 (11,36); 0,9258 (0,62); 0,9164 (0,76); 0,9129 (0,77); 0,9030 (0,89); 0,8928 (0,48); 0,8894 (0,48); 0,8796 (0,37); 0,3514 (0,46); 0,3418 (0,60); 0,3376 (0,62); 0,3285 (1,14); 0,3193 (0,74);
		0,3148 (0,72); 0,3059 (0,53); 0,1629 (0,57); 0,1540 (0,72); 0,1496 (0,73); 0,1405 (1,14); 0,1315 (0,60); 0,1267 (0,58); 0,1176 (0,42); -0,0002 (2,12)
Пример 11	[DMSO-D ₆]	8,9749 (2,05); 7,8618 (1,99); 7,8607 (1,98); 7,3679 (2,94); 5,7688 (3,02); 4,2956 (0,88); 4,2720 (1,06); 4,0848 (0,99); 4,0611 (0,85); 3,3252 (21,56); 3,3204 (19,55); 2,5191 (0,40); 2,5098 (9,86); 2,5056 (19,34); 2,5013 (27,16); 2,4970 (18,75); 2,4927 (9,26); 2,1861 (11,05); 0,9537 (16,00); -0,0002 (8,62)

Примеры применения

Пример А. Тест на *Alternaria* (томаты)/защитный.

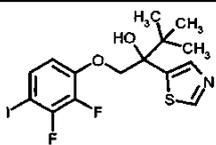
Растворитель: 49 вес.ч. N,N-диметилформамида.

Эмульгатор: 1 вес.ч. алкиларилполиглицолевого эфира.

Для получения необходимого препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгаторы и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации. Для испытания защитной эффективности молодые растения томатов опрыскивают препаратом биологически активного вещества с приведенным расходным количеством. Через 1 день после обработки растения инокулируют суспензией *Alternaria solani* и оставляют после этого на 24 ч при относительной влажности воздуха 100% и температуре 22°C. Затем растения выдерживают при относительной влажности воздуха 96% и температуре 20°C. Спустя 7 дней после инокуляции проводят оценку. При этом 0% означает степень эффективности, соответствующую контролю, в то время как эффективность 100% означает, что не наблюдается никакого поражения.

В этом тесте следующие соединения согласно данному изобретению при концентрации биологически активного вещества 500 млн.долей показывают эффективность 70% или более.

Таблица А

Тест на <i>Alternaria</i> (томаты)/защитный			
№	Биологически активное вещество	Расходное количество (млн. долей)	Эффективность (%)
1		500	100

Пример В. Тест на *Sphaerotheca* (огурцы)/защитный.

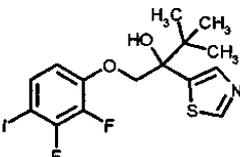
Растворитель: 49 вес.ч. N,N-диметилформамида.

Эмульгатор: 1 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения необходимого препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгаторы и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации. Для испытания защитной эффективности молодые растения огурцов опрыскивают препаратом биологически активного вещества с приведенным расходным количеством. Через 1 день после обработки растения инокулируют суспензией спор *Sphaerotheca fuliginea*. Затем растения помещают в теплицу при относительной влажности воздуха 70% и температуре 23°C. Спустя 7 дней после инокуляции проводят оценку. При этом 0% означает степень эффективности, соответствующую контролю, в то время как эффективность 100% означает, что не наблюдается никакого поражения.

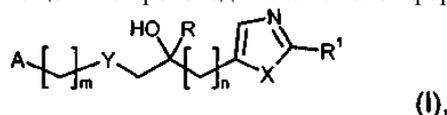
В этом тесте следующие соединения согласно данному изобретению при концентрации биологически активного вещества 500 млн. долей показывают эффективность 70% или более.

Таблица В

Тест на <i>Sphaerotheca</i> (огурцы)/защитный			
№	Биологически активное вещество	Расходное количество (млн. долей)	Эффективность (%)
1		500	94

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Гетероциклические тиозамещенные производные алканолов формулы (I)



в которой X означает S;

Y означает O;

m означает 0;

n означает 0;

R означает линейный или разветвленный (C₃-C₇)алкил или не замещенный или замещенный галоидом или (C₁-C₄)алкилом (C₃-C₇)циклоалкил;

R¹ означает водород, SH, (C₁-C₄)алкилтио-, (C₁-C₄)алкоксигруппу или галоид;

A означает в каждом случае трехкратно замещенный заместителем Z фенил, причем заместители Z одинаковы или различны;

Z означает галоид, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)галоидалкил, (C₁-C₄)алокси-, (C₁-C₄)галоидалкокси-, (C₁-C₄)алкилтио- или (C₁-C₄)галоидалкилтиогруппу,

а также их соли присоединения к кислоте или комплексы с солями металлов.

2. Гетероциклические тиозамещенные производные алканолов формулы (I) по п. 1,

в которой X означает S;

Y означает O;

m означает 0;

n означает 0;

R означает трет-бутил, изопропил, 1-хлорциклопропил, 1-фторциклопропил или 1-

метилциклопропил;

R¹ означает водород;

A означает в каждом случае трехкратно замещенный заместителем Z фенил, причем заместители Z одинаковы или различны;

Z означает галоид, (C₁-C₄)алкил или (C₁-C₄)галоидалкилтиогруппу.

3. Гетероциклические тиозамещенные производные алканолов формулы (I) по п.1 или 2, в которой X означает S;

Y означает O;

m означает 0;

n означает 0;

R означает трет-бутил или 1-метилциклопропил;

R¹ означает водород;

A означает в каждом случае трехкратно замещенный заместителем Z фенил, причем заместители Z одинаковы или различны;

Z означает галоид, (C₁-C₄)алкил или (C₁-C₄)галоидалкилтиогруппу.

4. Способ борьбы с патогенными для растений вредными грибами, отличающийся тем, что гетероциклические производные алканолов формулы (I) по пп.1, 2 или 3 наносят на патогенные для растений вредные грибы и/или на среду их обитания.

5. Средство для борьбы с патогенными для растений вредными грибами, отличающееся тем, что содержит как минимум одно гетероциклическое производное алканолов формулы (I) по пп.1, 2 или 3, а также наполнители и/или поверхностно-активные вещества.

6. Средство по п.5, содержащее как минимум одно дополнительное биологически активное вещество из группы, которая включает инсектициды, аттрактанты, стерилизаторы, бактерициды, акарициды, нематоды, фунгициды, регуляторы роста растений, гербициды, удобрения, защитные вещества и полухимикаты.

7. Применение гетероциклических производных алканолов формулы (I) по пп.1, 2 или 3 для борьбы с патогенными для растений вредными грибами.

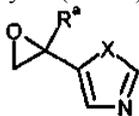
8. Применение гетероциклических производных алканолов формулы (I) по пп.1, 2 или 3 в качестве регуляторов роста растений.

9. Способ получения средств для борьбы с патогенными для растений вредными грибами, отличающийся тем, что гетероциклические производные алканолов формулы (I) по пп.1, 2 или 3 смешивают с наполнителями и/или поверхностно-активными веществами.

10. Применение гетероциклических производных алканолов формулы (I) по пп.1, 2 или 3 для обработки трансгенных растений.

11. Применение гетероциклических производных алканолов формулы (I) по пп.1, 2 или 3 для обработки семенного материала, а также семенного материала трансгенных растений.

12. Производные оксирана формулы (VIII-a)



(VIII-a),

в которой X означает O или S,

R^a означает линейный или разветвленный (C₃-C₇)алкил (за исключением трет-бутила в том случае, когда X означает S) или не замещенный или замещенный галоидом или (C₁-C₄)алкилом (C₃-C₇)циклоалкил.

