

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(11) **022461**

(13) **B1**

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

(45) Дата публикации и выдачи патента
2016.01.29

(21) Номер заявки
201291265

(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 АЛКАНОЛА В КАЧЕСТВЕ ФУНГИЦИДОВ**

(31) **10164141.3; 61/350,514**

(32) **2010.05.27; 2010.06.02**

(33) **EP; US**

(43) **2013.06.28**

(86) **PCT/EP2011/058440**

(87) **WO 2011/147815 2011.12.01**

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

(72) Изобретатель:
**Низинг Карл Фридрих, Хельмке
Хендрик (DE), Кристо Пьер (FR),
Перис Горка, Тсучия Томоки, Вазнер
Пьер, Бентинг Юрген, Дамен Петер,
Вахендорфф-Нойманн Ульрике (DE)**

(74) Представитель:
Беляева Е.Н. (BY)

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

(57) Настоящее изобретение касается новых гетероциклических производных алканола, способа получения указанных соединений, средств, содержащих указанные соединения, а также их применения в качестве биологически активных соединений, в частности, для борьбы с вредными микроорганизмами при защите растений от вредителей и охране материалов и в качестве регуляторов роста растений.

B1

022461

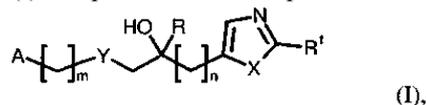
022461
B1

Настоящее изобретение касается новых гетероциклических производных алканола, способа получения указанных соединений, средств, содержащих указанные соединения, а также их применения в качестве биологически активных соединений, в частности, для борьбы с вредными микроорганизмами при защите растений от вредителей и охране материалов и в качестве регуляторов роста растений.

Уже известно, что для защиты растений в качестве фунгицидов и/или регуляторов роста можно применять определенные гетероциклические производные алканола (см. EP-A 0395175, EP-A 0409418).

Так как экологические и экономические требования, например, относительно спектра действия, токсичности, селективности, нормы расхода, образования осадка и благоприятного получения, к современным биологически активным веществам, например к фунгицидам, стремительно растут и, кроме того, могут возникать проблемы с устойчивостью, то существует постоянная необходимость в разработке новых фунгицидных средств, которые имеют преимущества, по меньшей мере, в под областях по сравнению с известными средствами.

Была найдена новая формула (I) гетероциклических производных алканола



в которой

X означает S,

Y означает O, -CH₂- или прямую связь,

m означает 0 или 1,

n означает 0 или 1,

R означает соответственно при необходимости разветвленный C₃-C₇-алкил, C₁-C₈-галогеналкил, C₂-C₇-алкенил, C₂-C₇-галогеналкенил, замещенный при необходимости галогеном, C₁-C₄-алкилом, C₁-C₄-галоалкилом, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галоалкокси, C₁-C₄-галоалкилтио или C₁-C₄-алкилтио, C₃-C₇-циклоалкил, а также при необходимости замещенный от одного до трех раз галогеном или C₁-C₄-алкилом фенил,

R¹ означает водород или галоген,

A означает соответственно фенил, двукратно замещенный Z, причем оба заместителя Z могут быть одинаковыми или различными,

Z означает галоген, циано, нитро, OH, SH, C(C₁-C₅-алкил)(=NO(C₁-C₅)-алкил), C₃-C₇-циклоалкил, C₁-C₄-алкил, C₁-C₄-галогеналкил, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкокси, C₁-C₄-алкилтио, C₁-C₄-галогеналкилтио, C₂-C₄-алкенил, C₂-C₄-галогеналкенил, C₂-C₄-алкинил, C₂-C₄-галогеналкинил, C₁-C₄-алкилсульфинил, C₁-C₄-галогеналкилсульфинил, C₁-C₄-алкилсульфонил, C₁-C₄-галогеналкилсульфонил, формил, C₂-C₅-алкилкарбонил, C₂-C₅-галогеналкилкарбонил, C₂-C₅-алкоксикарбонил, C₂-C₅-галогеналкоксикарбонил, C₃-C₆-алкенилокси, C₃-C₆-алкинилокси, C₂-C₅-алкилкарбонилокси, C₂-C₅-галогеналкилкарбонилокси, триалкилсиллил или соответственно при необходимости однократно замещенные галогеном, C₁-C₄-алкилом, C₁-C₄-галогеналкилом, C₁-C₄-алкокси или C₂-C₄-алкилкарбонилом фенил, фенокси или фенилтио,

а также их агрохимически активные соли.

Такие имеющиеся в продаже соли также обнаруживают фунгицидные и/или регулирующие рост растений свойства.

Применяемые согласно изобретению гетероциклические производные алканола определены общей формулой (I). Предпочтительные определения остатков вышеупомянутых и нижеследующих формул указаны далее. Эти определения называют конечные продукты формулы (I), а также все промежуточные продукты (см. также далее "Разъяснение способа и промежуточных продуктов").

X означает предпочтительно S.

Y означает предпочтительно O.

Y означает также предпочтительно -CH₂-.

Y означает также предпочтительно прямую связь.

Y означает особенно предпочтительно O.

Y означает также особенно предпочтительно -CH₂-.

m означает предпочтительно 0.

m означает также предпочтительно 1.

n означает предпочтительно 0.

n означает также предпочтительно 1.

R означает особенно предпочтительно соответственно при необходимости разветвленный C₃-C₅-алкил, C₁-C₆-галогеналкил, C₃-C₅-алкенил, C₃-C₅-галогеналкенил, при необходимости замещенный галогеном, C₁-C₄-алкилом, C₁-C₄-галоалкилом, C₁-C₄-галоалкокси, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галоалкилтио или C₁-C₄-алкилтио C₃-C₆-циклоалкил.

R означает весьма предпочтительно трет-бутил, изопропил, 1-хлорциклопропил, 1-фторциклопропил, 1-метилциклопропил, 1-метоксициклопропил, 1-метилтиоциклопропил, 1-трифторметил-

циклопропил, (3E)-4-хлор-2-метилбут-3-ен-2-ил, C₁-C₄-галогеналкил.

R¹ предпочтительно означает водород или галоген.

R¹ означает особенно предпочтительно водород, SH, метилтио, этилтио, метокси, этокси, фтор, хлор, бром или иод.

A означает предпочтительно фенил, дважды замещенный Z, причем оба заместителя Z являются одинаковыми или различными.

A означает особенно предпочтительно фенил, замещенный Z во 2 и 4 позиции, причем оба заместителя Z являются одинаковыми или различными.

A означает также особенно предпочтительно фенил, замещенный Z в 3 и 4 позиции, причем оба заместителя Z являются одинаковыми или различными.

A означает также особенно предпочтительно фенил, замещенный Z в 3 и 5 позиции, причем оба заместителя Z являются одинаковыми или различными.

Z означает предпочтительно галоген, циано, нитро, C(C₁-C₅-алкил)(=NO(C₁-C₅-алкил)), C₃-C₆-циклоалкил, C₁-C₄-алкил, C₁-C₄-галогеналкил, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкокси, C₁-C₄-алкилтио, C₁-C₄-галогеналкилтио, C₂-C₄-алкенил, C₂-C₄-алкинил, C₁-C₄-алкилсульфинил, C₁-C₄-алкилсульфонил, C₂-C₅-алкилкарбонил, C₂-C₅-алкоксикарбонил, C₃-C₆-алкенилокси, C₃-C₆-алкинилокси, C₂-C₅-алкилкарбонилокси, или однократно замещенный при необходимости галогеном, C₁-C₄-алкилом, C₁-C₄-галогеналкилом, C₁-C₄-алкокси или C₂-C₄-алкилкарбонилом фенил, фенокси или фенилтио.

Z означает особенно предпочтительно галоген, циано, нитро, C(C₁-C₄-алкил)(=NO(C₁-C₄-алкил)), C₃-C₆-циклоалкил, C₁-C₄-алкил, C₁-C₂-галогеналкил, C₁-C₂-алкокси, C₁-C₂-галогеналкокси, C₁-C₂-алкилтио, C₁-C₂-галогеналкилтио, C₁-C₂-алкилсульфинил, C₁-C₂-алкилсульфонил, ацетил, метоксикарбонил, этоксикарбонил, метилкарбонилокси или соответственно при необходимости однократно замещенный галогеном, C₁-C₂-алкилом, C₁-C₂-галогеналкилом, C₁-C₂-алкокси, ацетилом фенил, фенокси или фенилтио.

Z означает весьма предпочтительно фтор, хлор, бром, иод, циано, нитро, CH(=NOMe), циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, метил, этил, n-пропил, изопропил, n-, изо-, втор- или трет-бутил, трифторметил, трихлорметил, дифторметил, дихлорметил, дифторхлорметио, метокси, трифторметокси, дифторметокси, метилтио, трифторметилтио, дифторметилтио или соответственно при необходимости однократно замещенный фтором, хлором, бромом, иодом, метилом, этилом, трифторметилом, трихлорметилом, дифторметилом, дихлорметилом, дифторхлорметилом, метокси, ацетилом фенил, фенокси или фенилтио.

Тем не менее, вышеназванные в общих или в предпочтительных областях определения остатков или разъяснений можно комбинировать между собой любым способом, т.е. между данными и предпочтительных областей. Они считаются конечными продуктами, а также соответственно полуфабрикатами и промежуточными продуктами. Кроме того, отдельные определения могут выпадать.

Предпочтительными являются такие соединения формулы (I), в которой все остатки имеют соответственно вышеназванные предпочтительные значения.

Особенно предпочтительными являются такие соединения формулы (I), в которой все остатки имеют соответственно вышеназванные особенно предпочтительные значения.

Весьма предпочтительными являются такие соединения формулы (I), в которой все остатки имеют соответственно вышеназванные весьма предпочтительные значения.

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

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

Далее предпочтительными являются соединения формулы (I), в которой Y означает прямую связь.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

Ранее названные определения остатков можно использовать между собой в любой комбинации. Кроме того, отдельные определения могут выпадать.

В названных в этих формулах определениях символов использовали общие понятия, которые обычно означают следующие заместители:

Галоген: (также в смесях как галогеналкил, галогеналкокси и т.д.) фтор, хлор, бром и йод;

Алкил: (также в смесях как алкилтио, алкокси и т.д.) насыщенные, с прямой цепью или разветвленные углеводородные остатки с 1-8 атомами углерода, например C₁-C₆-алкил, 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.

Галогеналкил: (также в смесях как галогеналкилтио, галогеналкокси и т.д.) с прямой цепью или разветвленные алкильные группы с 1-8 атомами углерода (как уже было названо), где в этих группах частично или полностью атомы водорода, как уже было названо, могут быть замещены атомами галогена, например C₁-C₃-галогеналкил, 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-дифторэтил, 2,2-дихлор-2-фторэтил, 2,2,2-трихлорэтил, пентафторэтил и 1,1,1-трифторпроп-2-ил.

Алкенил: ненасыщенные, с прямой цепью или разветвленные углеводородные остатки с 2-8 атомами углерода и двойной связью в любой позиции, например C₂-C₆-алкенил 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 с 3-8 членами углеродных колец, как циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептил и циклооктил.

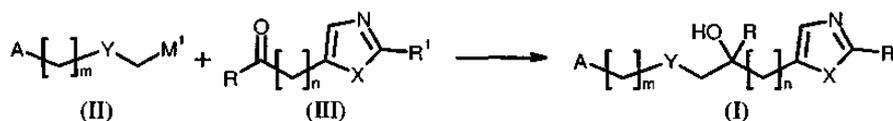
Арил: незамещенное или замещенное, ароматическое, моно-, би- или трициклическое кольцо, например фенил, нафтил, антраценил (антрил), фенантраценил (фенантрил).

Гетарил: незамещенное или замещенное, ненасыщенное гетероциклическое 5-7-членное кольцо, содержащее до 4 атомов азота или альтернативно 1 атом азота и до 2 других гетероатомов, выбранных из N, O и S: например, 2-фурила, 3-фурила, 2-тиенила, 3-тиенила, 2-пирролила, 3-пирролила, 1-пирролила, 3-пиразолила, 4-пиразолила, 5-пиразолила, 1-пиразолила, 1Н-имидазол-2-ила, 1Н-имидазол-4-ила, 1Н-имидазол-5-ила, 1Н-имидазол-1-ила, 2-оксазолила, 4-оксазолила, 5-оксазолила, 2-тиазолила, 4-тиазолила, 5-тиазолила, 3-изоксазолила, 4-изоксазолила, 5-изоксазолила, 3-изотиазолила, 4-изотиазолила, 5-изотиазолила, 1Н-1,2,3-триазол-1-ила, 1Н-1,2,3-триазол-4-ила, 1Н-1,2,3-триазол-5-ила, 2Н-1,2,3-триазол-2-ила, 2Н-1,2,3-триазол-4-ила, 1Н-1,2,4-триазол-3-ила, 1Н-1,2,4-триазол-5-ила, 1Н-1,2,4-триазол-1-ила, 4Н-1,2,4-триазол-3-ила, 4Н-1,2,4-триазол-4-ила, 1Н-тетразол-1-ила, 1Н-тетразол-5-ила, 2Н-тетразол-2-ила, 2Н-тетразол-5-ила, 1,2,4-оксадиазол-3-ила, 1,2,4-оксадиазол-5-ила, 1,2,4-тиадиазол-3-ила, 1,2,4-тиадиазол-5-ила, 1,3,4-оксадиазол-2-ила, 1,3,4-тиадиазол-2-ила, 1,2,3-оксадиазол-4-ила, 1,2,3-оксадиазол-5-ила, 1,2,3-тиадиазол-4-ила, 1,2,3-тиадиазол-5-ила, 1,2,5-оксадиазол-3-ила, 1,2,5-тиадиазол-3-ила, 2-пиридинила, 3-пиридинила, 4-пиридинила, 3-пиридазинила, 4-пиридазинила, 2-пиримидинила, 4-пиримидинила, 5-пиримидинила, 2-пиразинила, 1,3,5-триазин-2-ила, 1,2,4-триазин-3-ила, 1,2,4-триазин-5-ила, 1,2,4-триазин-6-ила.

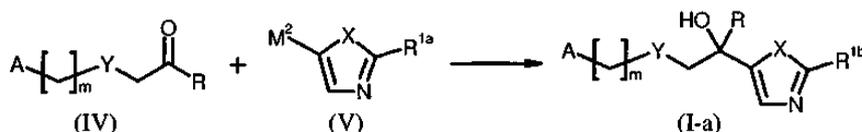
Разъяснение способов и промежуточных продуктов

Гетероциклические производные алканола формулы (I) можно получать различными способами (см. EP-A 0409418). Ниже возможные способы представлены схематично. Если не указано другого, то данные остатки имеют вышеуказанные значения.

Схема 1: Способ А



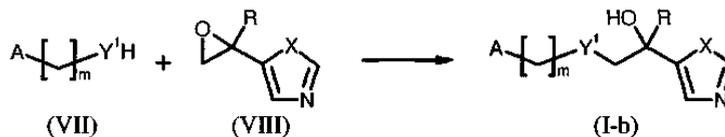
M^1 означает металл или галогенид металла, например, литий, магний (Mg-Hal , с $\text{Hal} =$ галоген), титан [$\text{Ti}(\text{OAlk})_3$, с $\text{Alk} = \text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$].

Схема 2: Способ В ($n = 0$)

M^2 означает металл, например, литий.

R^{1a} означает хлор и $\text{Si}(\text{алкил})_3$.

R^{1b} означает водород, хлор и $\text{Si}(\text{алкил})_3$.

Схема 3: Способ С ($n = 0, \text{R}^1 = \text{H}$)

Y^1 означает O.

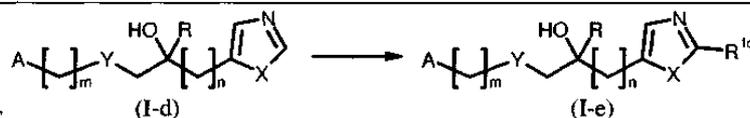
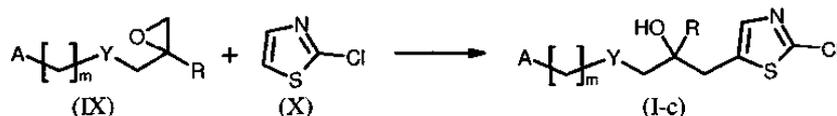
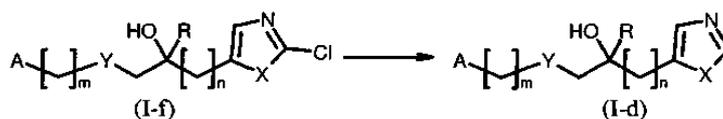
Схема 4: Способ D ($\text{X} = \text{S}, n = 1, \text{R}^1 = \text{хлор}$)

Схема 5: Способ E

R^{1c} означает SH, алкилтио, алкокси, галоген, галогеналкил, галогеналкилтио, галогеналкокси, циано, нитро.

Схема 6: Способ F



Предпочтительные определения остатков вышеупомянутых и нижеследующих формул и схем уже

указаны. Эти определения указывают не только конечные продукты формулы (I), а также и все промежуточные продукты.

Способ А.

Необходимые в качестве исходных веществ для проведения способа согласно изобретению А соединения формулы (II) частично известны. Их можно получить обычным способом (см., например, "Неорганическая общая химия" 2001, 627, 2408-2412).

Необходимые далее в качестве исходных веществ способа согласно изобретению А кетоны формулы (III) известны (см. EP-A 0409418).

Способ А согласно изобретению обычно проводят в присутствии разбавителя, например диэтилового эфира, тетрагидрофурана или дихлорметана, при температурах от -80 до +80°C. Полученный продукт поглощается донором протона.

Реакцию обмена согласно изобретению проводят предпочтительно в атмосфере инертного газа, в частности азота или аргона.

Способ В.

Необходимые в качестве исходных веществ для проведения способа В согласно изобретению кетоны формулы (IV) частично известны. Их можно получить обычным способом (см. EP-A 0409418).

Необходимые далее в качестве исходных веществ способа согласно изобретению В металлоорганические гетероциклические соединения формулы (V) известны (см. EP-A 0409418 и EP-A 0395175).

Для получения металлоорганических гетероциклических соединений формулы (V) 2 позицию при необходимости можно предпочтительно снабдить подходящей защитной группой, например триметилсилилом, чтобы M² направить в 5 позицию. Эту защитную группу можно, но не обязательно, отделять перед реакцией с кетонами формулы (IV).

Способ В согласно изобретению обычно проводят в присутствии разбавителя, например тетрагидрофурана или диэтилового эфира, при температурах от -120 до +80°C. Полученный продукт поглощается донором протона.

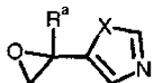
Реакцию обмена согласно изобретению проводят предпочтительно в атмосфере инертного газа, в частности азота или аргона.

Способ С.

Необходимые в качестве исходных веществ для проведения способа С согласно изобретению соединения формулы (VII) известны.

Необходимые далее в качестве исходных веществ для проведения способа С согласно изобретению производные оксирана формулы (VIII) частично известны.

Новыми являются производные оксирана формулы (VIII-a)



(VIII-a),

в которой

X имеет вышеназванное значение,

R^a означает предпочтительно соответственно при необходимости разветвленный C₃-C₇-алкил (кроме трет-бутила, если X означает S), C₁-C₈-галогеналкил, C₂-C₇-алкенил, C₂-C₇-галогеналкенил, при необходимости замещенный галогеном, C₁-C₄-алкилом, C₁-C₄-галоалкилом, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галоалкокси, C₁-C₄-галоалкилтио или C₁-C₄-алкилтио, C₃-C₇-циклоалкил, а также при необходимости замещенный от одного до трех раз галогеном или C₁-C₄-алкилом фенил.

R^a означает особенно предпочтительно соответственно при необходимости разветвленный C₃-C₅-алкил, кроме трет-бутила, C₁-C₆-галогеналкил, C₃-C₅-алкенил, C₃-C₅-галогеналкенил, при необходимости замещенный галогеном, C₁-C₄-алкилом, C₁-C₄-галоалкилом, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галоалкокси, C₁-C₄-галоалкилтио или C₁-C₄-алкилтио, C₃-C₆-циклоалкил.

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

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

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

Способ D.

Необходимые для проведения способа D согласно изобретению в качестве исходных веществ производные оксирана формулы (IX) частично известны (см. EP-A 0121171).

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

Для реакции обмена формулы IX можно применять металлоорганические соединения, в частности соединения алкиллития (например, n-бутиллитий) (см. EP-A 0395175).

Способ D согласно изобретению обычно проводят в присутствии разбавителя, например тетрагид-

рофурана или диэтилового эфира, при температурах от -120 до $+80^{\circ}\text{C}$. Полученный продукт поглощается донором протона.

Реакцию обмена согласно изобретению проводят предпочтительно в атмосфере инертного газа, в частности азота или аргона.

Способ E.

Соединения формулы (I-d), полученные в рамках вышеназванных способов, можно дальше преобразовывать в необходимые соединения общей структуры (I-e).

Для реакции обмена соединений формулы (I-d) можно применять металлоорганические соединения, в частности соединения алкиллития (например, *n*-бутиллитий) (см. EP-A 0906292).

Промежуточно возникшее металлоорганическое соединение обычно превращают электрофилом (например, серой, алкилгалогенидом, согалогенным соединением) в необходимое соединение (I-e).

Способ E согласно изобретению обычно проводят в присутствии разбавителя, например тетрагидрофурана или диэтилового эфира, при температурах от -120 до $+80^{\circ}\text{C}$. Полученный продукт поглощается донором протона.

Реакцию обмена согласно изобретению проводят предпочтительно в атмосфере инертного газа, в частности азота или аргона.

Способ F.

Соединения формулы (I-f), полученные в рамках вышеназванных способов, можно дальше преобразовывать в необходимые соединения общей структуры (I-d).

Для реакции обмена соединений формулы (I-f) можно применять металлы, предпочтительно цинк (см. EP-A 0395175).

Способ F согласно изобретению обычно проводят в присутствии разбавителя, например тетрагидрофурана, или также органических кислот, например уксусной кислоты, при температурах от -120 до $+150^{\circ}\text{C}$.

Согласно изобретению гетероциклические производные алканола общей формулы (I) можно превращать в соли кислотного присоединения или комплексы солей металлов.

Для получения физиологически совместимых солей кислотного присоединения соединений общей формулы (I) предпочтительно принимают во внимание следующие кислоты: галогеноводородные кислоты, как, например, соляная кислота и бромисто-водородная кислота, в частности соляная кислота, кроме того, фосфорная кислота, азотная кислота, серная кислота, моно- и бифункциональные карбоновые кислоты и гидроксикарбоновые кислоты, как, например, уксусная кислота, малеиновая кислота, янтарная кислота, фумаровая кислота, винная кислота, лимонная кислота, салициловая кислота, сорбиновая кислота, молочная кислота, а также сульфоновые кислоты, как, например, *p*-толуолсульфоновая кислота и 1,5-нафталиндисульфоновая кислота.

Соли кислотного присоединения соединений общей формулы (I) можно получить простым способом обычными методами солеобразования, например растворить соединения общей формулы (I) в подходящем инертном растворителе и добавить кислоту, например соляную кислоту, и очистить известным способом, например отфильтрованием, выделением, и, при необходимости, промыть инертным органическим растворителем.

Для получения комплексов солей металлов соединений общей формулы (I) предпочтительно принимают во внимание соли металлов II-IV основных групп и I и II, а также IV-VIII подгруппы Периодической системы элементов, причем в качестве примера должны быть названы медь, цинк, марганец, магний, олово, железо и никель.

В качестве анионов солей принимают во внимание те, которые предпочтительно происходят от следующих кислот: галоидоводородные кислоты, как, например, соляная кислота и бромисто-водородная кислота, кроме того, фосфорная кислота, азотная кислота и серная кислота.

Комплексы солей металлов соединений общей формулы (I) можно получить простым способом обычными методами, так, например, растворить соли металла в спирте, например этаноле, и добавить к соединению общей формулы I. Можно выделить комплексы солей металлов известным способом, например отфильтровать и при необходимости очистить с помощью перекристаллизации.

Далее данное изобретение касается средства защиты растений, содержащего биологически активные вещества, для борьбы с нежелательными микроорганизмами, в частности с нежелательными грибами. Предпочтительно означает фунгицидное средство, которое содержит применяемые в сельском хозяйстве добавки, растворители, наполнители, поверхностно-активные вещества или разбавители.

Кроме того, изобретение касается способа борьбы с нежелательными микроорганизмами, отличающегося тем, что биологически активные вещества согласно изобретению наносят на фитопатогенные грибы и/или их среду обитания.

Наполнитель согласно изобретению означает природное или синтетическое, органическое или неорганическое вещество, с которым смешивают или соединяют биологически активные вещества для лучшей применимости, прежде всего для нанесения на растения, или части растений, или семена. Наполнитель, который может быть твердым или жидким, в общем, является инертными и должен подходить для применения в сельском хозяйстве.

В качестве твердых или жидких наполнителей принимают во внимание, например, соли аммония и натуральную каменную муку, как каолины, глины, тальк, мел, кварц, аттапульгит, монтмориллонит или диатомовая земля, и синтетическую каменную муку, как высокодисперсная кремневая кислота, оксид алюминия и природные или синтетические силикаты, смолы, воски, твердые удобрения, вода, спирты, в частности бутанол, органические растворители, минеральные и растительные масла, а также их производные. Также можно использовать смеси таких наполнителей. В качестве твердых наполнителей для гранулятов принимают во внимание, например, дробленые и фракционированные натуральные камни, как кальцит, мрамор, пемза, сепиолит, доломит, а также синтетические грануляты из неорганической и органической муки, а также грануляты из органических материалов, как древесные опилки, скорлупа кокосового ореха, кукурузные початки и стебли табачных растений.

В качестве сжиженных газообразных разбавителей или наполнителей принимают во внимание такие жидкости, которые при нормальной температуре и при нормальном давлении являются газообразными, например аэрозольные пропелленты, как галогенуглеводороды, а также бутан, пропан, азот и диоксид углерода.

Можно использовать в композициях промоторы адгезии, как карбоксиметилцеллюлоза, натуральные и синтетические порошковые, гранулированные полимеры или полимеры в виде латекса, как гуммиарабик, поливиниловый спирт, поливинилацетат, а также натуральные фосфолипиды, как кефалины и лецитины, и синтетические фосфолипиды. Другими добавками могут быть минеральные и растительные масла.

В случае использования воды в качестве разбавителя также можно применять, например, органический растворитель в качестве вспомогательного растворителя. В качестве жидких растворителей обычно используют ароматические соединения, как ксилол, толуол или алкилнафталин, хлорированные ароматические соединения или хлорированные алифатические углеводороды, как хлорбензолы, хлорэтилены или дихлорметан, алифатические углеводороды, как циклогексан или парафины, например нефтяные фракции, минеральные и растительные масла, спирты, как бутанол или гликоль, а также их простые и сложные эфиры, кетоны, как ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон или циклогексанон, сильнополярные растворители, как диметилформамид и диметилсульфоксид, а также вода.

Средства согласно изобретению дополнительно могут содержать другие компоненты, как, например, поверхностно-активные вещества. В качестве поверхностно-активных веществ принимают во внимание эмульгаторы и/или пенообразователи, диспергаторы или смачиватели с ионными или неионными свойствами или смеси этих поверхностно-активных веществ. Примерами этого являются соли полиакриловой кислоты, соли лигносульфоновой кислоты, соли фенолсульфоновой кислоты или нафталинсульфоновой кислотой, полимеры, полученные поликонденсацией этиленоксида с алифатическими спиртами или с кислотами жирного ряда или с аминами жирного ряда, замещенными фенолами (предпочтительно алкилфенолы или арилфенолы), соли сложных эфиров сульфоянтарной кислоты, производные таурина (предпочтительно алкилтаураты), сложный эфир фосфорной кислоты полиэтоксилированных спиртов или фенолов, сложный эфир кислоты жирного ряда многоатомных спиртов, и производные соединений, содержащих сульфаты, сульфонаты и фосфаты, например простой алкиларилполигликолевый эфир, алкилсульфонаты, алкилсульфаты, арилсульфонаты, белковые гидролизаты, лигнинсульфитные отработанные щелочи и метилцеллюлоза. Присутствие поверхностно-активного вещества необходимо, если одно из биологически активных веществ и/или один из инертных наполнителей не растворяются в воде, и если применение осуществляют в воде. Количество поверхностно-активных веществ составляет 5-40 мас.% средства согласно изобретению.

Можно использовать такие красители, как неорганические пигменты, например окись железа, оксид титана, берлинская лазурь, и органические красители, как ализариновые красители, азокрасители и металлофталоцианиновые красители, и микроэлементы, как соли железа, марганца, бора, меди, кобальта, молибдена и цинка.

Также при необходимости могут содержаться другие дополнительные компоненты, например защитные коллоиды, связующие вещества, клеящие вещества, сгустители, триксотропные вещества, вещества, улучшающие проникновение, стабилизаторы, комплексообразующие вещества и добавки. В общем, биологически активные вещества можно комбинировать с любой твердой или жидкой добавкой, которую обычно используют для данного применения.

В общем средства и композиции согласно изобретению содержат 0,05-99 мас.%, 0,01-98 мас.%, предпочтительно 0,1-95 мас.%, особенно предпочтительно 0,5-90% биологически активного вещества, весьма предпочтительно 10-70 мас.%.

Биологически активные вещества или средства согласно изобретению можно применять в чистом виде или, в зависимости от их физических и/или химических свойств, в виде их препаративных форм или полученных из них форм применения, как аэрозоли, капсульные суспензии, концентраты для холодных и горячих туманов, гранулят в капсулах, мелкий гранулят, текучие концентраты для обработки семян, готовые к употреблению растворы, распыляемый порошок, эмульгируемые концентраты, эмульсии типа "масло в воде", эмульсии типа "вода в масле", макрогранулы, микрогранулы, диспергируемый в масле порошок, смешиваемые с маслом текучие концентраты, смешиваемые с маслом жидкости, пены, пасты,

покрытые пестицидами семена, суспензионные концентраты, суспензионно-эмульсионные концентраты, растворимые концентраты, суспензии, порошок для распыления, растворимый порошок, dust и грануляты, растворимые в воде грануляты или таблетки, растворимые в воде порошки для обработки семенного материала, порошок для смачивания, пропитанные биологически активным веществом натуральные и синтетические вещества, а также тонкие капсулы из полимерных материалов и оболочки для семян, а также препаративные формы для ULV-распыления холодного и горячего тумана.

Названные препаративные формы можно получать известным способом, например при смешивании биологически активного вещества по меньшей мере с одним обычным разбавителем, растворителем или разбавляющим средством, эмульгатором, диспергатором и/или связующим или фиксирующим средством, смачивателем, водным репеллентом, при необходимости, сиккативом и УФ-стабилизаторами и, при необходимости, с красителями и пигментами, пеногасителем, консервантом, вторичным сгустителем, клеящим веществом, гиббереллинами, а также другими технологическими добавками.

Средства согласно изобретению содержат не только композиции, которые уже готовы к использованию и могут наноситься с помощью подходящего оборудования на растения или семена, а также промышленные концентраты, которые перед использованием необходимо разбавлять водой.

Биологически активные вещества согласно изобретению могут существовать в чистом виде или в своих (обычных) препаративных формах, а также в полученных из этих препаративных форм формах применения при смешивании с другими (известными) биологически активными веществами, как инсектициды, аттрактанты, стерильянты, бактерициды, акарициды, нематодциды, фунгициды, регуляторы роста, гербициды, удобрения, защитные средства или семиохимикалии.

Обработку растений и частей растений согласно изобретению биологически активными веществами или средствами осуществляют непосредственно или с помощью воздействия на их окружающую среду, среду обитания или условия хранения обычными методами обработки, например окунанием, разбрызгиванием, опрыскиванием, распылением, орошением, обработкой паром, пульверизацией, опыливанием, разбрасыванием, посыпкой, нанесением пены, покрытия, намазыванием, обливанием, капельным орошением материала для размножения, в частности, семян, также сухим, мокрым протравливанием, протравливанием суспензий, нанесением покрытия, нанесением одно- или многослойной оболочки и т.д. Также можно наносить биологически активные вещества методом Ultra-Low-Volume ("сверхмалого объема") или нагнетать растворы биологически активных веществ/само биологически активное вещество в землю.

Также изобретение содержит способ обработки семян.

Также изобретение касается семян, которые обрабатывали одним описанным в предыдущем абзаце способом. Семенной материал согласно изобретению используют в способах защиты семян от нежелательных микроорганизмов. В них используют семена, обработанные по меньшей мере одним биологически активным веществом согласно изобретению.

Биологически активные вещества или средства согласно изобретению также подходят для обработки семян. Большая часть вреда культурным растениям наносится вредными организмами при поражении семян во время хранения или после посева, а также во время и после всхода растений. Эта фаза является особенно критической, так как корни и ростки растущих растений являются особенно чувствительными, и даже небольшое повреждение может привести к гибели растений. Поэтому большой интерес состоит в том, чтобы защитить семена и прорастающие растения с помощью применения подходящих средств.

Борьба с фитопатогенными грибами с помощью обработки семян растений известна давно и является предметом постоянных улучшений. Тем не менее, при обработке семян выявляется ряд проблем, которые не всегда можно решить положительно. Таким образом, стремятся получить способы защиты семян и прорастающих растений, которые делают излишним или, по меньшей мере, значительно уменьшают дополнительное нанесение средств защиты растений после посева или после прорастания растений. Также стремятся оптимизировать количество применяемого биологически активного вещества, чтобы защитить семена и прорастающие растения от поражения фитопатогенными грибами наилучшим образом, без нанесения вреда самому растению применяемыми биологически активными веществами. Также способы обработки семян должны использовать внутренние фунгицидные свойства трансгенных растений, чтобы достичь оптимальной защиты семян и прорастающих растений при минимальных затратах средств защиты растений.

Поэтому данное изобретение также касается способа защиты семян и прорастающих растений от поражения фитопатогенными грибами, в котором семена обрабатывают средством согласно изобретению. Также изобретение касается применения средств согласно изобретению для обработки семян для защиты семенного материала и прорастающих растений от фитопатогенных грибов. Далее изобретение касается семенного материала, который для защиты от фитопатогенных грибов обработали средством согласно изобретению.

Борьбу с фитопатогенными грибами, которые поражают растения после прорастания, осуществляют в первую очередь при обработке почвы и наземных частей растений средствами защиты растений. Из-за возможного влияния средств защиты растений на окружающую среду и здоровье людей и животных пытаются уменьшить количество наносимых биологически активных веществ.

Одним из преимуществ данного изобретения является то, что по причине особенных системных

свойств биологически активных веществ или средств согласно изобретению, обработка семян этими биологически активными веществами или средствами защищает не только сами семена, а также полученные из них растения после всхода от фитопатогенных грибов. По этой причине можно не проводить непосредственную обработку сельскохозяйственных культур в момент посева или сразу после него.

Таким образом, предпочтительным является то, что биологически активные вещества или средства согласно изобретению также можно применять на трансгенных семенах, причем растения, выросшие из этих семян, могут экспримировать протеин, действующий против этих вредителей. При обработке таких семян биологически активными веществами или средствами согласно изобретению с определенными вредителями можно также бороться, например, экспрессией инсектицидного белка. При этом неожиданно можно было наблюдать другой синергетический эффект, который дополнительно усиливает эффективность защиты от поражения вредителями.

Средства согласно изобретению подходят для защиты семян любого сорта растений, которые применяют в сельском хозяйстве, в теплице, в лесах или в садоводстве и виноделии. При этом, в частности, речь идет о семенах злаковых культур (как пшеница, ячмень, рожь, тритикале, просо и овес), кукурузы, хлопка, сои, риса, картофеля, подсолнечника, бобов, кофе, свеклы (например, сахарная и кормовая свекла), земляного ореха, рапса, мака, маслин, кокосового ореха, какао-бобов, сахарного тростника, табака, овощей (как томаты, огурцы, лук и салат), газона и декоративных растений (см. также ниже). Особое значение имеет обработка семян злаковых культур (как пшеница, ячмень, рожь, тритикале и овес), кукурузы и риса.

Как также описывается ниже, обработка трансгенных семян биологически активными веществами или средствами имеет особое значение. Это касается семян растений, которые содержат по меньшей мере один гетерологический ген, который способствует экспрессии полипептида или белка с инсектицидными свойствами. Гетерологический ген в трансгенных семенах может, например, происходить из микроорганизмов вида *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* или *Gliocladium*. Предпочтительно этот гетерологический ген происходит из *Bacillus* sp., причем генетический продукт действует против огневки кукурузной (European corn borer) и/или западного кукурузного жука. Особенно предпочтительно гетерологический ген происходит из *Bacillus thuringiensis*.

В рамках данного изобретения средство согласно изобретению наносят на семена отдельно или в подходящей препаративной форме. Предпочтительно семена обрабатывают в том состоянии, в котором оно является настолько стабильным, что при обработке не причиняется вреда. В общем, обработку семян можно осуществлять в любой момент времени между уборкой урожая и посевом. Обычно можно использовать семена, которые были отделены от растения и освобождены от початков, скорлупы, стеблей, внешних оболочек, шерсти или мякоти плода. Так, например, можно применять семена, которые собрали, очистили и высушили до содержания влаги менее 15 мас.%. Также альтернативно можно использовать семена, которые после высыхания, например, обработали водой и затем заново высушили.

В общем, при обработке семян необходимо обратить внимание на то, что количество средства согласно изобретению, нанесенного на семена, и/или других добавок выбирают таким образом, чтобы оно не вредило прорастанию семян или полученным из него растениям. Прежде всего, следует обратить внимание на те биологически активные вещества, которые при определенных нормах расхода обладают фитотоксическими эффектами.

Средства согласно изобретению можно наносить в чистом виде, т.е. без других компонентов и без последующего разбавления. Как правило, предпочитают наносить средства на семена в виде подходящей препаративной формы. Подходящие препаративные формы и способы обработки семян известны специалисту и описаны, например, в следующих документах: US 4272417, US 4245432, US 4808430, US 5876739, US 2003/0176428 A1, WO 2002/080675, WO 2002/028186.

Применяемые согласно изобретению биологически активные вещества можно преобразовывать в обычные препаративные формы-протравы, как растворы, эмульсии, суспензии, порошки, пены, затравочные суспензии или другие оболочки для семян, а также препаративные формы для применения в ультранизких объемах.

Эти препаративные формы получают обычным способом, в котором биологически активные вещества смешивают с обычными добавками, как, например, обычными разбавителями, а также растворителями или разбавляющими средствами, красителями, смачивателями, диспергаторами, эмульгаторами, пеногасителями, консервантами, вторичными сгустителями, клеящими веществами, гиббереллинами и также водой.

В качестве красителей, которые могут содержаться в применяемых согласно изобретению препаративных формах-протравах, принимают во внимание все подходящие для таких целей красители. При этом используют как малорастворимые, так и растворимые в воде красители. В качестве примеров должны быть названы известные красители под обозначениями Родамин Б, Пигмент красный Red 112 и Сольвент Red 1.

В качестве смачивателей, которые могут содержаться в применяемых согласно изобретению препаративных формах-протравах, принимают во внимание все способствующие увлажнению вещества, применяемые в препаративных формах агрохимических биологически активных веществ. Предпочтительно

применяют алкилнафталинсульфонаты, как диизопропил- или диизобутил-нафталинсульфонаты.

В качестве диспергаторов и/или эмульгаторов, которые могут содержаться в применяемых согласно изобретению препаративных формах-протравах, принимают во внимание все обычные неионные, анионные и катионные диспергаторы, применяемые в препаративных формах агрохимических биологически активных веществ. Предпочтительно используют неионные или анионные диспергаторы или смеси неионных или анионных диспергаторов. В качестве подходящих неионных диспергаторов необходимо назвать блок-сополимеры этиленоксид-пропиленоксида, простой эфир алкилфенолполигликоля, а также простого эфира тристирилфенолполигликоля и их фосфатированные или сульфатированные производные. Особенно подходящими анионными диспергаторами являются лигнинсульфонаты, соли полиакриловой кислоты и конденсаты арилсульфонатформальдегида.

В качестве пеногасителей в применяемых согласно изобретению препаративных формах-протравах могут содержаться все обычные для препаративной формы агрохимических биологически активных веществ противопенные средства. Предпочтительно применяют силиконовый пеногаситель и стеарат магния.

В качестве консервантов в применяемых согласно изобретению препаративных формах-протравах могут содержаться все применяемые для подобных целей в препаративных формах агрохимических биологически активных веществ вещества. В качестве примеров должны быть названы дихлорофен и гемиформаль бензилового спирта.

В качестве вторичных сгустителей, которые могут содержаться в применяемых согласно изобретению препаративных формах-протравах, принимают во внимание все используемые для таких целей в агрохимических средствах вещества. Предпочтительно принимают во внимание производные целлюлозы, производные акриловой кислоты, ксантен, модифицированные глины и высокодисперсную кремневую кислоту.

В качестве клеящих веществ, которые могут содержаться в применяемых согласно изобретению препаративных формах-протравах, принимают во внимание все обычные применяемые в протравах связующие вещества. В качестве примеров должны быть названы поливинилпирролидон, поливинилацетат, поливиниловый спирт и тилоза.

В качестве гиббереллинов, которые могут содержаться в применяемых согласно изобретению препаративных формах-протравах, предпочтительно принимают во внимание гиббереллины А1, А3 (= гиббереллиновая кислота), А4 и А7, особенно предпочтительно применяют гиббереллиновую кислоту. Гиббереллины известны (см. R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel" (P. Berger "Химия средств защиты растений и средств защиты от вредителей"), т. 2, изд. Springer, 1970, стр. 401-412).

Применяемые согласно изобретению препаративные формы-протравы можно использовать или в чистом виде, или после предварительного разбавления водой для обработки семян различными способами, также семян трансгенных растений. При этом при взаимодействии с образованными экспрессией веществами также могут возникать дополнительные синергитические эффекты.

Для обработки семян применяемыми согласно изобретению препаративными формами-протравами или полученными из них с помощью добавления воды препаратами обычно применяют во внимание смесители, используемые для протравливания. Во время протравливания семена кладут в мешалку, добавляют соответственно желаемое количество препаративной формы-протравы в чистом виде или после предварительного разбавления водой и перемешивают до равномерного распределения препаративной формы на семенах. При необходимости присоединяется процесс высушивания.

Биологически активные вещества или средства согласно изобретению обнаруживают сильное микробицидное влияние и могут применяться для борьбы с нежелательными микроорганизмами, как грибы и бактерии, для защиты растений и сырья.

Фунгициды можно применять при защите растений для борьбы с плазмодиофоромицетами (Plasmodiophoromycetes), оомицетами (Oomycetes), хитридиомицетами (Chytridiomycetes), зигомицетами (Zygomycetes), аскомицетами (Ascomycetes), базидиомицетами (Basidiomycetes) и дейтеромицетами (Deuteromycetes).

Бактерициды можно применять при защите растений для борьбы с псевдомонадами (Pseudomonadaeae), ризобиями (Rhizobiaceae), энтеробактериями (Enterobacteriaceae), коринебактериями (Corynebacteriaceae) и стрептомицетами (Streptomycetaceae).

Фунгицидные средства согласно изобретению можно применять для борьбы с фитопатогенными грибами в лечебных или защитных целях. Поэтому изобретение также касается способов лечения и защиты для борьбы с фитопатогенными грибами при использовании биологически активных веществ или средств согласно изобретению, которые можно наносить на семена, растения или части растений, плоды или землю, в которой растут растения.

Средства согласно изобретению для борьбы с фитопатогенными грибами для защиты растений содержат действующее, но не фитотоксичное количество биологически активных веществ согласно изобретению. "Действующее, но не фитотоксичное количество" означает количество средств согласно изобретению, которое является достаточным, чтобы в полной мере контролировать или полностью устра-

нить грибковое заболевание растения, и одновременно не обладает фитотоксичностью. Это применяемое количество, в общем, может варьироваться в больших пределах. Это зависит от многих факторов, например от вида гриба, растения, условий климата и состава средства согласно изобретению.

Хорошая переносимость растениями биологически активных веществ в необходимых для борьбы с заболеваниями растений концентрациях делает возможной обработку наземных частей растений, посадочного и посевного материала и почвы.

Согласно изобретению можно обрабатывать все растения или части растений. Под растениями при этом понимают все растения и растительные популяции, как желаемые и нежелательные дикорастущие или культурные растения (включая существующие в природе культурные растения). Культурными растениями могут быть растения, которые были получены методами традиционного разведения и оптимизирования или методами биотехнологии или генной инженерии или комбинацией этих методов, включая трансгенные растения и включая сорта растений, защищенных и незащищенных совокупностью правовых норм, регламентирующих порядок охраны новых сортов растений. Под частями растений должны пониматься все наземные и подземные части и органы растений, такие как побег, лист, цветок и корень, причем также листья, иглы, стебель, стволы, цветы, плодородное тело, плоды и семена, а также корни, клубни и корневища. К частям растений относят товарный продукт урожая, а также и вегетативный и генеративный материал для размножения, например черенки, клубни, корневище, отводки и семена.

Предлагаемые действующие вещества хорошо переносятся растениями, нетоксичны для теплокровных, экологически безвредны и подходят для защиты растений и их частей, для увеличения урожая, улучшения качества собранного урожая. Преимущественно применяются как средства защиты растений. Они действуют против нормальных чувствительных и устойчивых видов, а также против всех или отдельных стадий их развития.

В качестве растений, которые можно обрабатывать согласно изобретению, необходимо назвать следующие: хлопок, лен, виноградная лоза, фрукты, овощи, как Rosaceae sp. (например, семечковые плоды, как яблоко и груша, а также косточковые плоды, как абрикосы, вишни, миндаль и персики, и садовоягодные культуры, как земляника), 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, лук), Papilionaceae sp. (например, горох); основные технические культуры, как Gramineae sp. (например, кукуруза, газон, зерновые культуры, как пшеница, рожь, рис, ячмень, овес, просо и тритикале), Poaceae sp. (например, сахарный тростник), Asteraceae sp. (например, подсолнечник), Brassicaceae sp. (например, капуста белокочанная, капуста краснокочанная, брокколи, капуста цветная, капуста брюссельская, Пак-чой, кольраби, редис, а также рапс, горчица, хрен и клоповник), Fabaceae sp. (например, бобы, арахис), Papilionaceae sp. (например, соя), Solanaceae sp. (например, картофель), Chenopodiaceae sp. (например, сахарная свекла, кормовая свекла, мангольд, красная свекла); технические культуры и декоративные растения в саду и лесу; а также соответственно генетически модифицированные виды этих растений.

Как уже упоминалось выше, согласно изобретению можно обрабатывать все растения и их части. Дикорастущие или полученные такими традиционными биологическими методами, как скрещивание или синтез протопластов, виды и сорта растений, а также их части обрабатываются в одном из предпочтительных вариантов изобретения. В другом предпочтительном варианте изобретения обрабатываются трансгенные растения и их виды, которые были получены генно-инженерными способами при необходимости в комбинации с традиционными методами (генномодифицированные организмы) и их части. Понятие "части" или "части растений" или "растительные части" разъяснялось выше. Особенно предпочтительно согласно изобретению обрабатывают растения находящиеся в продаже или используемых сортов растений. Под сортами растений понимают растения с новыми качествами ("Traits"), которые были получены путем традиционного разведения, мутагенеза или рекомбинационной ДНК-технологии. Это могут быть сорта, био- и генотипы.

Способ обработки согласно изобретению можно использовать для обработки генетически модифицированных организмов (ГМО), например растений или семян. Генетически модифицированные растения (или трансгенные растения) - это растения, в которых гетерологический ген устойчиво интегрирован в геном. Понятие "гетерологический ген" обозначает в основном ген, который вырабатывается или соединяется вне растения и при во внедрении в клеточный геном, геном хлоропласта или митохондрический геном трансформируемых растений придает новые улучшенные агрономические или прочие свойства, чтобы заинтересованный протеин или полипептид экспримировались, или чтобы другой ген, который имеется в растении, или остальные гены, имеющиеся в растении, регулировались или отключались (например, при помощи антинаправленной технологии, Cosuppression-технологии или RNAi-технологии [RNA Interference]). Гетерологический ген, который имеется в геноме, также называют трансген. Трансген, который определяют его особым наличием в геноме растения, называют преобразованный или трансгенный результат (Event).

В зависимости от видов или сортов растений, места их произрастания и условий роста (почвы, климата, периода вегетации, питания) вследствие предлагаемой обработки могут появляться также сверхаддитивные ("синергические") эффекты. Так, например, возможны следующие эффекты, которые существенно превышают ожидаемые: сниженные нормы потребления и/или увеличенный спектр действия и/или усиленное действие применяемых согласно изобретению веществ и средств, лучший рост растений, повышенная толерантность к высоким или низким температурам, повышенная толерантность к сухости или к содержанию солей в воде и почве, повышенная продуктивность цветения, облегчение уборки урожая, ускорение созревания, увеличение размеров урожая, фрукты большего размера, более высокие растения, более интенсивный зеленый цвет листа, раннее цветение, улучшенное качество и/или повышенная пищевая ценность продукта урожая, повышенная концентрация сахара во фруктах, повышенная устойчивость при хранении и/или обрабатываемость продуктов урожая.

При определенных нормах расхода биологически активных веществ согласно изобретению могут также оказывать на растения укрепляющее действие. Поэтому они подходят для мобилизации защитной системы растений от поражения нежелательными фитопатогенными грибами и/или микроорганизмами и/или вирусами. При необходимости это может быть одной из причин повышенной эффективности комбинации согласно изобретению, например, против грибов. Укрепляющие растения (обладающие сопротивлением) вещества в данном контексте должны означать такие вещества или комбинации веществ, которые способны так стимулировать защитную систему растений таким образом, чтобы обработанные растения, если они привиты этим нежелательными фитопатогенными грибами, обнаруживали значительную степень устойчивости против этих нежелательных фитопатогенных грибов. Поэтому вещества согласно изобретению применяют для защиты растений от поражения названными патогенами в течение определенного периода времени после обработки. Период времени, в течение которого достигается защитное действие, охватывает в общем 1-10 дней, предпочтительно 1-7 дней, после обработки растений биологически активными веществами.

К растениям и сортам растений, которые предпочтительно обрабатывают согласно изобретению, относят все растения, которым придают особенно полезные, нужные свойства (не имеет значения, было ли это достигнуто в результате выращивания и/или биотехнологии).

Растения и сорта растений, которые также предпочтительно обрабатывают согласно изобретению, являются устойчивыми к одному или более биотическим стрессовым факторам, т.е. эти растения обнаруживают повышенную защиту от животных и микробиологических вредителей, таких как нематоды, насекомые, клещи, фитопатогенные грибки, бактерии, вирусы и/или вириды.

Растениями и сортами растений, которые также при необходимости можно обрабатывать согласно изобретению, являются такие растения, которые устойчивы к одному или нескольким абиотическим факторам. К абиотическим стрессовым предпосылкам можно отнести, например, засуху, холод и жару, осмотический стресс, скопление влаги, повышенное содержание соли в почве, повышенное содержание минералов, избыток озона, избыток освещения, ограниченное поступление азотных питательных веществ, ограниченное поступление фосфорных питательных веществ или предотвращение затенения.

К растениям и сортам растений, которые при необходимости можно обрабатывать согласно изобретению, относят такие растения, которые отличаются повышенной урожайностью. Повышенная урожайность у этих растений может основываться, например, на улучшенной физиологии растений, улучшенном росте растений и улучшенном развитии растений, как, например, эффективность использования воды, эффективность поглощения воды, улучшенное использование азота, повышенное усвоение углерода, улучшенный фотосинтез, улучшенная всхожесть и ускоренное созревание. На урожайность может влиять улучшенная архитектура растений (при стрессовых и нестрессовых условиях), среди них раннее цветение, контроль цветения для получения гибридных семян, улучшенный рост всходов, размер растений, количество и расстояние, рост корневой системы, размер семян, величина плодов, стручков, количество стручков или колосьев, количество семян в стручке или колосе, вес семян, усиленное наполнение семенами, ограниченная потеря семян, ограниченное растрескивание стручков, а также устойчивость. К следующим признакам урожайности относят состав семян, как, например, содержание углеводов, белка, содержание и состав масла, пищевая ценность, уменьшение вредных соединений, улучшенная обрабатываемость и улучшенное хранение.

Растения, которые обрабатывают согласно изобретению, являются гибридными растениями, которые несут в себе свойства гетерозиса или гибридного эффекта, что, в общем, ведет к высокому урожаю, улучшенному росту, улучшенному здоровью и лучшей сопротивляемости к биотическим или абиотическим стрессовым факторам. Такие растения обычно получают благодаря тому, что выведенная путём инцукта родительская линия со стерильной пылью (женский гибридный продукт) перекрещивается с другой выведенной путём инцукта родительской линией со стерильной пылью (мужской гибридный продукт). Гибридные семена обычно собирают с растений со стерильной пылью и продают размножителю. Растения со стерильной пылью (например, кукурузу) можно иногда получать при механическом удалении мужских половых органов или мужских цветов; однако обычно считают, что стерильность пыльцы основывается на генетических детерминантах в растительном геноме. В этом случае, в частности, тогда, если желательный продукт, который хотят получить от гибридного растения, называется се-

менами, обычно является благоприятным, что стерильность пыльцы в гибридных растениях, которые содержат ответственные за пыльцу генетические детерминанты, полностью ресторируется. Это может быть достигнуто тем, что мужской гибридный партнер обладает соответствующими репродуктивными остаточными органами, которые в состоянии ресторировать репродуктивную способность пыльцы в гибридных растениях, которые содержат генетические детерминанты, ответственные за стерильность пыльцы. Для стерильности пыльцы генетические детерминанты могут локализоваться в цитоплазме. Примеры цитоплазматической стерильности пыльцы, описаны, например, для видов Brassica. Также генетические детерминанты для стерильности пыльцы могут локализоваться в геноме клеточного ядра. Растения со стерильной пыльцой могут также быть получены методами растительной биотехнологии, как, например, генная инженерия. Особенно благоприятный способ получения растений со стерильной пыльцой описан в WO 89/10396, причем, например, рибонуклеаза как барназа выборочно прикрепляется в клетки тапетума в тычинке. Репродуктивная способность может восстанавливаться экспрессией тормозящих раздражителей рибонуклеазы как барстар в клетках тапетума.

Растения или сорта растений (которые получены методами растительной биотехнологии, как генная инженерия), которые могут обрабатываться согласно изобретению, являются толерантными к гербицидам, т.е. растения, которые стали толерантными по отношению к одному или нескольким заданным гербицидам. Такие растения могут быть получены или генетической трансформацией или селекцией растений, которые содержат мутацию, придающую такую толерантность к гербицидам.

Растениями, толерантными к гербицидам, являются, например, растения, толерантные к гербициду глифосату, т.е. растения, которые стали толерантными по отношению к гербициду глифосату или его солям. Так, например, растения, толерантные к глифосату, получают трансформацией растений геномом, который кодирован для энзима 5-энолпирувилшкимат-3-фосфатсинтаза (EPSPS). Примерами подобных EPSPS-генов являются AroA-ген (мутированный штамм CT7) бактерии *Salmonella typhimurium*, CP4-ген бактерии *Agrobacterium sp.*, гены, которые кодируют для EPSPS из петунии, для EPSPS из томатов или для EPSPS из дагуссы. Также речь может идти о мутированном EPSPS. Растения, толерантные к глифосату, могут также быть получены вследствие того, что ген экспримируется, кодируется как глифосат-оксидоредуктаза-энзим. Растения, толерантные к глифосату, могут также быть получены вследствие того, что ген экспримируется, кодируется как глифосат-ацетилтрансфераза-энзим. Растения, толерантные к глифосату, могут также быть получены при селекции растений, которые содержат природные существующие мутации вышеназванных генов.

Другими устойчивыми к гербицидам растениями являются, например, растения, которые стали толерантными к гербицидам, которые ингибируют энзим глутаминсинтазы, как, например, биалафос, фосфинотрицин или глюфосинат. Такие растения могут быть получены при экспримировании энзима, который дезактивирует гербицид или мутант энзима глутаминсинтазы, устойчивого к ингибированию. Таким действующим дезактивирующим энзимом является, например, энзим, кодирующий фосфинотрицин-ацетилтрансферазу (как, например, бар- или пат-протеин из вида стрептомицетов). Растения, которые экспримируют экзогенную фосфинотрицин-ацетилтрансферазу, описаны.

Другими толерантными к гербицидам растениями являются также растения, которые стали толерантными к гербицидам, ингибирующим энзим гидроксифенилпируватдиоксигеназы (ГФПД). Гидроксифенилпируватдиоксигеназы означают энзимы, которые катализируют реакцию, превращающую парагидроксифенилпируват (НРР) в гомогентизат. Растения, толерантные, по отношению к ГФПД-блокаторам, можно трансформировать геном, который кодирует природный устойчивый ГФПД-ген, или геном, который кодирует мутирующий ГФПД-энзим. Толерантность к ГФПД-блокаторам также может быть достигнута при трансформации растений с генами, кодирующими определенные энзимы, которые делают возможным образование гомогентизата, несмотря на блокирование природного ГФПД-энзима ГФПД-блокатором. Толерантность по отношению к ГФПД-блокаторам может быть улучшена при дополнительном превращении растений в ген, кодирующий ГФПД-толерантный энзим, геном, кодирующий префенатдегидрогеназа-энзим.

Другими устойчивыми по отношению к гербицидам растениями являются растения, которые стали толерантными к ацетолактатсинтазе (ALS)-блокаторам. К известным ALS-блокаторам относят, например, сульфонилмочевину, имидазолинон, триазолопиримидин, пиримидинилокси(тио)бензоат и/или сульфониламинокарбонилтриазолиноновые гербициды. Известно, что различные мутации в энзиме ALS (известном также как синтаза ацетогидроксикислоты АНАС) придают толерантность к различным гербицидам или группам гербицидов. Получение растений, толерантных к сульфонилмочевине, и растений, толерантных к имидазолинону, описано в международной публикации WO 1996/033270. Другие, толерантные к сульфонилмочевине и имидазолинону растения описаны также, например, в WO 2007/024782.

Другие растения, которые являются толерантными к сульфонилмочевине и/или к имидазолинону, могут быть получены индуцированным мутагенезом, селекцией клеточных культур в присутствии гербицида или мутационным разведением.

Растения или сорта растений (которые получены методами растительной биотехнологии, как генная инженерия), которые также при необходимости могут быть обработаны согласно изобретению, являются устойчивыми к насекомым трансгенными растениями, т.е. растениями, которые стали устойчивыми к

поражению известными целевыми насекомыми. Такие растения могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, которые содержат мутацию, придающую такую устойчивость к насекомым.

Понятие "устойчивые к насекомым трансгенные растения" охватывает в данном контексте каждое растение, которое содержит по меньшей мере один трансген, содержащий кодирующую последовательность, которая кодирует следующим образом:

1) инсектицидный кристаллический протеин, состоящий из *Bacillus thuringiensis* или одной его инсектицидной части, как инсектицидные кристаллические протеины, которые были описаны в http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/, или их инсектицидных частей, например протеинов, или Cry-протеинов Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Ae или Cry3Bb, или их инсектицидных частей; или

2) кристаллический протеин из *Bacillus thuringiensis* или одной его части, которая в присутствии второго, другого кристаллического протеина в виде *Bacillus thuringiensis* или одной его части оказывает инсектицидное действие, как двойной токсин, который состоит из кристаллических протеинов Cry34 и Cry35; или

3) инсектицидный гибридный протеин, который содержит части двух различных инсектицидных кристаллических протеинов из *Bacillus thuringiensis*, как, например, гибрид из протеинов 1) выше или гибрид из протеинов 2) выше, например протеин Cry1A.105, который получают из кукурузы MON98034 (WO 2007/027777); или

4) протеин согласно одному из пп. 1)-3) выше, в котором некоторые, в частности 1-10, аминокислоты замещены другими аминокислотами, чтобы достичь высокой инсектицидной эффективности к виду целевых насекомых, и/или чтобы расширить спектр соответствующих видов целевых насекомых, и/или ради изменений, которые индуцированы в кодированной DNA во время клонирования или преобразования, как протеин Cry3Bb1 в кукурузе MON863 или MON88017 или протеин Cry3A в кукурузе MIR 604;

5) инсектицидный выделенный протеин из *Bacillus thuringiensis* или *Bacillus cereus* или его инсектицидной части, как вегетативно действующие инсектицидные протеины (вегетативно инсектицидные протеины, ВИП), которые названы на http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, например протеины протеинового класса VIP3Aa; или

6) протеин, выделенный из *Bacillus thuringiensis* или *Bacillus cereus*, который в присутствии одного второго протеина, выделенного из *Bacillus thuringiensis* или *B. Cereus*, действует инсектицидно, как двойной токсин, который состоит из протеинов VIP1A и VIP2A;

7) инсектицидный гибридный протеин, который содержит части различных протеинов, выделенных из *Bacillus thuringiensis* или *Bacillus cereus*, как гибрид протеина 1) или гибрид протеина 2) выше; или

8) протеин по одному из пп. 1)-3) выше, в котором некоторые, в частности 1-10, аминокислоты были замещены другими аминокислотами для достижения высокой инсектицидной эффективности к виду целевых насекомых, и/или для расширения спектра соответствующих видов целевых насекомых, и/или ради изменений, индуцированных в кодированной DNA во время клонирования или преобразования (причем кодирование инсектицидных протеинов сохраняется), как протеин VIP3Aa в хлопке COT 102.

Также к устойчивым к насекомым трансгенным растениям в данном контексте относят каждое растение, которое содержит комбинацию генов, кодирующих один из вышеназванных классов 1-8. В форме выполнения изобретения одно устойчивое к насекомым растение содержит более одного трансгена, который кодирует протеин по одному из вышеназванных пп. 1-8 для расширения спектра соответствующих видов целевых насекомых или для замедления развития устойчивости насекомых к растениям при использовании различных протеинов, которые являются инсектицидными для тех же самых видов целевых насекомых, однако показывают различные принципы действия, как присоединение к различным местам блокирования рецептора в насекомом.

Растения или виды растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, как генная инженерия), которые при необходимости согласно изобретению могут подвергаться обработке, являются толерантными к абиотическим стрессовым факторам. Такие растения могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, которые содержат мутацию, придающую такую устойчивость к стрессам. К особенно полезным растениям с устойчивостью к стрессам относят следующие:

а) растения, которые содержат один трансген, который может снизить экспрессию и/или активность гена для поли(ADP-рибоза)полимеразы (PARP) в клетках растений или растениях;

б) растения, которые содержат один трансген, способствующий толерантности к стрессам, который может ограничить экспрессию и/или активность PARP кодирующего гена растений или растительных клеток;

с) растения, которые содержат один трансген, способствующий толерантности к стрессам, который кодирует в растениях функциональный фермент способом никотинададениндинуклеотидселвидж-биосинтеза, в том числе никотинамидаза, никотинатфосфорибосилтрансфераза, ниацинмононуклеотидаденилтрансфераза, никотиоинамидадениндинуклеотидсинтеза или никотинамидфосфорибосилтрансфераза.

Растения или сорта растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, как генная инженерия), которые при необходимости можно обрабатывать согласно изобретению, обнаруживают измененное количество, качество и/или стабильность при хранении продукции урожая и/или измененные свойства определенных составных частей продукции урожая, как, например:

1) трансгенные растения, синтезирующие модифицированный крахмал, который изменен по своим химико-физическим качествам, в частности, относительно содержания амилозы или соотношения амилоза/амилопектин, степени разветвления, средней длины цепи, размещения боковой цепи, свойств вязкости, прочности геля, величины размера зерен и/или морфологии размера зерен в сравнении с синтезированным крахмалом в клетках дикорастущих растений или в дикорастущих растениях таким образом, что он лучше подходит для известного применения;

2) трансгенные растения, синтезирующие некрахмально-углеводные полимеры или некрахмально-углеводные полимеры, которые изменяют свойства по сравнению с дикорастущими растениями без генетических модификаций. Примерами являются растения, которые производят полифруктозу, особенно типа инулинов и леванов, растения, которые производят альфа-1,4-глюкан, растения, которые производят альфа-1,6-разветвленный альфа-1,4-глюкан, и растения, которые производят альтернан;

3) трансгенные растения, которые производят гиалуронан.

Растения или сорта растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, как генная инженерия), которые также могут быть обработаны согласно изобретению, являются растениями, как растения хлопчатника с измененными свойствами волокна. Такие растения могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, которые содержат мутацию, придающую такие измененные свойства волокна; к ним относятся:

a) растения, как растения хлопчатника, которые содержат измененную форму генов целлюлозосинтазы,

b) растения, как растения хлопчатника, которые содержат измененную форму rsw2- или rsw3-гомологических нуклеиновых кислот,

c) растения, как растения хлопчатника с повышенной экспрессией сахарозофосфатсинтазы,

d) растения, как растения хлопчатника с повышенной экспрессией сахарозосинтазы,

e) растения, как растения хлопчатника, у которых момент пропускного регулирования протоплазматических соединений между клетками изменяется на основании клеток волокна, например, при регулировании β -1,3-глюканазы с избранными волокнами,

f) растения, как растения хлопчатника с волокнами с измененной реакционной способностью, например с помощью экспрессии гена N-ацетилглюкозаминтрансферазы, в том числе также podC, и генов хитинсинтазы.

Растения или сорта растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, как генная инженерия), которые также могут быть обработаны согласно изобретению, являются растениями, как рапс или растения, родственные Brassica с измененными свойствами состава масла. Такие растения могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, которые содержат мутацию, придающую такие измененные свойства масла; к ним относятся:

a) растения, как рапсовые растения, которые вырабатывают масло с высоким содержанием олеиновой кислоты;

b) растения, как рапсовые растения, которые вырабатывают масло с низким содержанием линолевой кислоты;

c) растения, как рапсовые растения, которые вырабатывают масло с низким содержанием насыщенной жирной кислоты.

Особенно полезные трансгенные растения, которые можно обрабатывать согласно изобретению, являются растениями с одним или несколькими генами, которые кодируют один или несколько токсинов, являются трансгенными растениями, которые предлагаются под следующими торговыми названиями: YIELD GARD® (например, кукуруза, хлопок, соевые бобы), KnockOut® (например, кукуруза), BiteGard® (например, кукуруза), BT-Xtra® (например, кукуруза), StarLink® (например, кукуруза), Bollgard® (хлопок), Nucleon® (хлопок), Nucleon 33B® (хлопок), NatureGard® (например, кукуруза), Protecta® и NewLeaf® (картофель). Толерантными к гербицидам растениями, которые следует упомянуть, являются, например, сорта кукурузы, хлопка и сои, которые предлагаются под следующими торговыми названиями: Roundup Ready® (толерантные к глифосату, например кукуруза, хлопок, соя), Liberty Link® (толерантные к фосфинотрицину, например рапс), IMI® (толерантные к имидазолинону) и SCS® (толерантные к сульфонилкарбамиду, например кукуруза). К устойчивым к гербицидам растениям (традиционно выращенным на толерантности к гербицидам растениям), которые нужно упомянуть, относят сорта (например, кукурузы), предложенные под названием Clearfield®.

Особенно полезными трансгенными растениями, которые можно обрабатывать согласно изобретению, являются растения, которые содержат результат преобразования или комбинацию результатов преобразования, которые, например, указываются в файлах различных национальных или региональных ведомств (см., например, http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx и <http://www.agbios.com/dbase.php>).

Кроме того при защите сырья можно использовать биологически активные вещества или средства для защиты технического сырья от поражения и уничтожения нежелательными микроорганизмами, например грибами и насекомыми.

Соединения согласно данному изобретению сами по себе или в комбинации с другими биологически активными веществами обнаруживают очень хорошее противообрастающее действие.

Под техническими материалами в данном контексте понимают неживые материалы, которые были получены для технического использования. Например, техническими материалами, которые необходимо защищать биологически активными веществами от микробиологического изменения или разрушения, могут быть клеи, глины, бумага, строительный картон и обычный картон, текстиль, ковровые изделия, кожа, древесина, покрасочные средства и пластмасса, охлаждающие смазывающие вещества и другие материалы, которые могут поражаться и уничтожаться нежелательными микроорганизмами. В рамках материалов, которые необходимо защищать, также следует назвать детали промышленного оборудования и зданий, например циркуляция охлаждающей воды, охлаждающие системы и системы отопления, вентиляционные установки и кондиционеры, которым может причинять вред размножение микроорганизмов. В рамках данного изобретения в качестве технических материалов должны быть предпочтительно названы связующее вещество, клей, бумага и картон, кожа, древесина, покрасочные средства, смазочно-охлаждающая жидкость и жидкие теплоносители, особенно предпочтительно древесина. Биологически активные вещества или средства согласно изобретению могут снижать такие отрицательные эффекты, как истлевание, разложение, изменение цвета, обесцвечивание или плесневение. Кроме того, соединения согласно изобретению можно использовать для защиты от обрастания предметов, более предпочтительно, таких как корпуса кораблей, сита, рыболовные сети, строительные сооружения, причалы и сигнализационные установки, которые соприкасаются с морской водой или со сточными водами.

Согласно изобретению способы борьбы с нежелательными грибами также можно применять для защиты так называемых складированных товаров. При этом под "складированными товарами" понимают природные вещества растительного или животного происхождения или продукты их переработки, которые имеют природное происхождение и нуждаются в длительной защите. Складированные товары растительного происхождения, как, например, растения или части растений, как черенки, листья, клубни, семена, плоды, зерна, можно защищать сразу после сбора урожая или после высушивания, увлажнения, измельчения, размалывания, отжима или обжарки. Складированным товаром также является деловая древесина в необработанном виде, как строительный материал, линии электропередач и шлагбаум, или в виде готового продукта, как мебель. Складированными товарами животного происхождения являются, например, мех, кожа, шкура и волосы. Биологически активные вещества согласно изобретению могут снижать такие отрицательные эффекты, как истлевание, разложение, изменение цвета, обесцвечивание или плесневение.

В качестве примеров, но, не ограничиваясь данным изобретением, должны быть названы некоторые возбудители грибковых заболеваний, которые можно обрабатывать согласно изобретению:

заболевания, вызванные возбудителем настоящей мучнистой росы, как, например, виды рода *Blumeria*, как, например, *Blumeria graminis*; виды рода *Podosphaera*, как, например, *Podosphaera leucotricha*; виды рода *Sphaerotheca*, как, например, *Sphaerotheca fuliginea*; виды рода *Uncinula*, как, например, *Uncinula necator*;

заболевания, вызванные возбудителем ржавчины, как, например, виды рода гимноспорангиум (*Gymnosporangium*), как, например, *Gymnosporangium sabinae*; виды рода *Hemileia*, как, например, *Hemileia vastatrix*; виды рода *Phakopsora*, как, например, *Phakopsora pachyrhizi* и *Phakopsora meibomia*; виды рода *Puccinia*, как, например, *Puccinia recondita*; виды рода уромизес (*Uromyces*), как, например, *Uromyces appendiculatus*;

заболевания, вызванные возбудителем группы оомицетов, как, например, виды рода *Bremia*, как, например, *Bremia lacusae*; виды рода *Peronospora*, как, например, *Peronospora pisi* или *P. brassicae*; виды рода *Phytophthora*, как, например, *Phytophthora infestans*; виды рода плазмопара (*Plasmopara*), как, например, *Plasmopara viticola*; виды рода псевдопероноспора (*Pseudoperonospora*), как, например, *Pseudoperonospora humuli* или *Pseudoperonospora cubensis*; виды рода питиум (*Pythium*), как, например, *Pythium ultimum*;

пятнистость и увядание листьев, вызванные, например, видами рода альтернария (*Alternaria*), как, например, *Alternaria solani*; видами рода церкоспора (*Cercospora*), как, например, *Cercospora beticola*; видами рода *Cladosporium*, как, например, *Cladosporium cucumerinum*; видами рода *Cochliobolus*, как, например, *Cochliobolus sativus* (форма конидии: *Drechslera* (пятнистость), син.: *Helminthosporium*); видами рода коллетотрихум (*Colletotrichum*), как, например, *Colletotrichum lindemuthianum*; видами рода *Cyloconium*, как, например, *Cyloconium oleaginum*; видами рода диапорте (*Diaporthe*), как, например, *Diaporthe citri*; видами рода *Elsinoe*, как, например, *Elsinoe fawcettii*; видами рода *Gloeosporium*, как, например, *Gloeosporium laeticolor*; видами рода гломерелла (*Glomerella*), как, например, *Glomerella cingulata*; видами рода гиньярдия (*Guignardia*), как, например, *Guignardia bidwelli*; видами рода лептосферия (*Leptosphaeria*), как, например, *Leptosphaeria maculans*; видами рода *Magnaporthe*, как, например, *Magnaporthe grisea*; видами рода *Mycosphaerella*, как, например, *Mycosphaerella graminicola*; видами рода

Phaeosphaeria, как, например, *Phaeosphaeria nodorum*; видами рода пиренофора (*Pyrenophora*), как, например, *Pyrenophora teres*; видами рода рамулярии (*Ramularia*), как, например, *Ramularia collo-cygni*; видами рода *Rhynchosporium*, как, например, *Rhynchosporium secalis*; видами рода *Septoria*, как, например, *Septoria arii*; видами рода *Typhula*, как, например, *Typhula incarnata*; видами рода *Venturia*, как, например, *Venturia inaequalis*;

заболевания корней и стеблей, вызванные, например, видами рода кортициум (*Corticium*), как, например, *Corticium graminearum*; видам рода фузариум (*Fusarium*), как, например, *Fusarium oxysporum*; видами рода *Gaeumannomyces*, как, например, *Gaeumannomyces graminis*; видами рода *Rhizoctonia*, как, например, *Rhizoctonia solani*; видами рода тапезия (*Tapesia*), как, например, *Tapesia acuformis*; видами рода тиелавиопсис (*Thielaviopsis*), как, например, *Thielaviopsis basicola*;

заболевания колосьев и метелок (включая початки кукурузы), вызванные, например, видами рода *Alternaria*, как, например, *Alternaria* spp.; видами рода аспергилл (*Aspergillus*), как, например, *Aspergillus flavus*; видами рода *Cladosporium*, как, например, *Cladosporium* spp.; видами рода *Claviceps*, как, например, *Claviceps purpurea*; видами рода фузариум (*Fusarium*), как, например, *Fusarium culmorum*; видами рода гибберелла (*Gibberella*), как, например, *Gibberella zeae*; видами рода *Monographella*, как, например, *Monographella nivalis*; видами рода *Septoria*, как, например, *Septoria nodorum*;

заболевания, вызванные, например, головнёвыми, как, например, видами рода сфацелотек (*Sphaelotheca*), как, например, *Sphaelotheca reiliana*; видами рода тиллетия (*Tilletia*), как, например, *T. caries*; видами рода *Urocystis*, как, например, *Urocystis occulta*; видами рода *Ustilago*, как, например, *Ustilago nuda* *U. nuda tritici*;

загнивание плодов, вызванные, например, видами рода аспергилл (*Aspergillus*), как, например, *Aspergillus flavus*; видами рода *Botrytis*, как, например, *Botrytis cinerea*; видами рода пеницилл (*Penicillium*), как, например, *Penicillium expansum* и *P. purpurogenum*; видами рода склеротиния (*Sclerotinia*), как, например, *Sclerotinia sclerotiorum*;

видами рода вертицилл (*Verticillium*), как, например, *Verticillium albo-atrum*;

прикорневая гниль и увядание, гниль и увядание семян, а также заболевания сеянцев, вызванные, например, видами рода фузариум (*Fusarium*), как, например, *Fusarium culmorum*; видами рода фитотфтора (*Phytophthora*), как, например, *Phytophthora cactorum*; видами рода питиум (*Pythium*), как, например, *Pythium ultimum*; видами рода *Rhizoctonia*, как, например, *Rhizoctonia solani*; видами рода *Sclerotium*, как, например, *Sclerotium rolfsii*;

раковые заболевания, наросты и ведьмина метла, вызванные, например, видами рода нектрия (*Nectria*), как, например, *Nectria galligena*;

увядание, вызванное, например, видами рода монилия (*Monilinia*), как, например, *Monilinia laxa*;

деформации листьев, цветков и плодов, вызванные, например, видами рода тафрина (*Taphrina*), как, например, *Taphrina deformans*;

заболевания вырождения древесных растений, вызванные, например, видами рода *Esca*, как, например, *Phaemoniella clamydospora* и *Phaeoacremonium aleophilum* и *Fomitiporia mediterranea*;

заболевания цветов и семян, вызванные, например, видами рода *Botrytis*, как, например, *Botrytis cinerea*;

заболевания клубней растений, вызванные, например, видами рода *Rhizoctonia*, как, например, *Rhizoctonia solani*; видами рода гелинхоспориум (*Helminthosporium*), как, например, *Helminthosporium solani*;

заболевания, вызванные бактериальными возбудителями, как, например, видами рода *Xanthomonas*, как, например, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*; видами рода псевдомонас (*Pseudomonas*), как, например, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*; видами рода эрвиния (*Erwinia*), как, например, *Erwinia amylovora*.

Предпочтительно борются со следующими заболеваниями сои:

грибковые заболевания листьев, стеблей, стручков и семян, вызванные, например, пятнистостью листьев *Alternaria* (*Alternaria* spec, *atrans tenuissima*), антракнозом (*Anthracoze*) (*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*), бурой пятнистостью (*Septoria glycines*), пятнистостью листьев *Cercospora* и увяданием (*Cercospora kikuchii*), *Choanephora* увяданием листьев (*Choanephora infundibulifera trispora* (Syn.)), *Dactuliophora* пятнистостью листьев (*Dactuliophora glycines*), ложной мучнистой росой (*Peronospora manshurica*), *Drechslerae* увяданием (*Drechslera glycini*), церкоспорозной пятнистостью листьев ("глаз лягушки") (*Cercospora sojae*), *Leptosphaerulina* пятнистостью листьев (*Leptosphaerulina trifolii*), филлостиктозной пятнистостью листьев (*Phyllosticta sojaecola*), ложной мучнистой росой (*Microsphaera diffusa*), *Pyrenochaeta* пятнистостью листьев (*Pyrenochaeta glycines*), *Rhizoctonia* воздушным, листовым и паутинным увяданием (*Rhizoctonia solani*), ржавчиной (*Phakopsora pachyrhizi*), паршой (*Sphaceloma glycines*), *Stemphylium* увяданием листьев (*Stemphylium botryosum*), мишеневидной пятнистостью (*Corynespora cassicola*).

Грибковые заболевания корней и основания стебля, вызванные, например, черной гнилью корней (*Calonectria crotalariae*), угольной гнилью корней (*Macrophomina phaseolina*), фузариозным увяданием или усыханием, гнилью корней и гнилью стручка или шейки (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium orthoceras*, *Fusa-*

rium semitectum, Fusarium equiseti), Mycoleptodiscus корневая гниль (Mycoleptodiscus terrestris), Neocosmopora (Neocosmopora vasinfecta), увядание стручков и стеблей (Diaporthe phaseolorum), некроз стволов (Diaporthe phaseolorum var. caulivora), фитофторная гниль (Phytophthora megasperma), бурая стволовая гниль (Phialophora gregata), питиозная гниль (Pythium aphanidermatum, Pythium irregulare, Pythium debaryanum, Pythium myriotylum, Pythium ultimum), корневая гниль Rhizoctonia, стволовая гниль, и черная ножка (Rhizoctonia solani), склероциальная гниль стеблей (Sclerotinia sclerotiorum), южное склероциальное увядание (Sclerotinia rolfsii), гниль корней Thielaviopsis (Thielaviopsis basicola).

В качестве микроорганизмов, которые могут влиять на уменьшение или изменение технических материалов, должны быть названы, например, бактерии, грибки, дрожжи, водоросли и слизистые организмы. Предпочтительно биологически активные вещества действуют согласно изобретению против грибов, в частности плесневых грибов, обесцвечивающих и разрушающих дерево грибов (базиомицетов), а также против слизистых организмов и водорослей. Предпочтительно, например, должны быть названы микроорганизмы следующих видов: альтернария (Alternaria), как Alternaria tenuis; аспергилл (Aspergillus), как Aspergillus niger; Chaetomium, как Chaetomium globosum; кониофора (Coniophora), как Coniophora puetana; лентинус (Lentinus), как Lentinus tigrinus; пенициллиум (Penicillium), как Penicillium glaucum; полипорус (Polyporus), как Polyporus versicolor; Aureobasidium, как Aureobasidium pullulans; Sclerophoma, как Sclerophoma pityophila; триходерма (Trichoderma), как Trichoderma viride; эшерихия (Escherichia), как Escherichia coli; псевдомонас (Pseudomonas), как Pseudomonas aeruginosa; стафилококк (Staphylococcus), как Staphylococcus aureus.

Кроме того, биологически активные вещества обнаруживают очень хорошее антимикотическое действие. Они имеют очень широкий антимикотический спектр действия, в частности, против дерматофитов и почкующейся плесени, плесени и двухфазных грибов (например, против вида кандиды, как Candida albicans, Candida glabrata), а также видов Epidermophyton floccosum, видов аспергилл как Aspergillus niger и Aspergillus fumigatus, видов трихофитон, как Trichophyton mentagrophytes, видов Microsporon как Microsporon canis и audouinii. Перечень этих грибов никоим образом не ограничен доступным пониманию антимикотическим спектром, а имеет только пояснительный характер.

Биологически активные вещества также можно использовать как в лечебных, так и в нелечебных целях.

При использовании биологически активных веществ согласно изобретению нормы использования могут изменяться в широких пределах в зависимости от способа применения. Норма расхода биологически активных веществ согласно изобретению составляет

при обработке частей растений, например листьев: 0,1-10000 г/га, предпочтительно 10-1000 г/га, особенно предпочтительно 50-300 г/га (при использовании полива или капельного метода орошения норма применения даже может снижаться, прежде всего, если используют инертные субстраты, как минеральная вата или перлит);

при обработке семян: 2-200 г на 100 кг семян, предпочтительно 3-150 г на 100 кг семян, особенно предпочтительно 2,5-25 г на 100 кг семян, весьма предпочтительно 2,5-12,5 г на 100 кг семян;

при обработке почвы: 0,1-10000 г/га, предпочтительно 1-5000 г/га.

Эти нормы расхода являются примерными и не ограничиваются изобретением.

Таким образом, биологически активные вещества или средства можно использовать для защиты растений в течение определенного промежутка времени после обработки от поражения названными вредителями. Период времени, в течение которого осуществляется защита, в общем, составляет 1-28 дней, предпочтительно 1-14 дней, особенно предпочтительно 1-10 дней, весьма предпочтительно 1-7 дней после обработки растений биологически активными веществами или до 200 дней после обработки семенного материала.

Кроме того, при обработке согласно изобретению в собранном урожае и полученных из него продуктах питания и кормах может снижаться содержание микотоксинов. Особенно, но не ограничиваясь данным изобретением, должны быть названы следующие микотоксины: деоксиниваленол (DON), ниваленол, 15-ацетил-DON, 3-ацетил-DON, T2- и HT2-токсин, фумонизины, зеараленон, монилиформин, фузарин, диацетоксисцирпенол (DAS), бьюферин, энниатин, фузаропротрофериин, фузаренол, охратоксин, патулин, алкалоиды спорыньи и афлатоксины, которые, например, вызваны следующими грибами: видами рода фузариум (Fusarium), как, например, 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 видами рода аспергилл (Aspergillus), видами рода пеницилл (Penicillium), видами рода Claviceps purpurea, видами рода стахитоботрис (Stachybotrys) и др.

Согласно изобретению соединения можно применять при необходимости в определенных концентрациях или соответственно расходного количества также в виде гербицидов, защитных средств, регуляторов роста или средств улучшения свойств растений или в виде микробицидов, например фунгицидов, противогрибковых средств, бактерицидов, вирицидов (включая средства против вирицидов) или в виде средств против MLO (Mycoplasma-like-organism (организм типа микоплазмы)) и RLO (Rickettsia-like-

organism (организм типа рикеттсии)). При необходимости их также можно применять как промежуточные или исходные продукты для синтеза других биологически активных веществ.

Биологически активные вещества согласно изобретению вмешиваются в метаболизм растений и поэтому их также можно применять в качестве регуляторов роста.

Регуляторы роста растений могут оказывать на растения различное влияние. Действие веществ существенно зависит от момента применения относительно стадии развития растения, а также от количества биологически активных веществ, наносимых на растения или их окружающую среду, и от способа применения. В каждом случае регуляторы роста должны оказывать влияние на культурные растения определенным желаемым способом.

Вещества, регулирующие рост растений, можно применять, например, сдерживания роста растений. В том числе такое сдерживание роста имеет хозяйственный интерес для трав, так как благодаря этому можно сокращать частоту укоса травы в декоративных садах, парках и стадионах, на краях дороги, на аэродромах или фруктовых садах. Также важным является сдерживание роста травянистых растений и деревьев на краю дороги и вблизи трубопроводов или линий электропередач или вообще в областях, в которых нежелателен сильный рост растений.

Важным также является применение регуляторов роста для остановки роста зерновых культур в длину. Тем самым снижается или полностью устраняется опасность переламывания ("полегания") растений перед уборкой урожая. Кроме того, регуляторы роста злаковых культур могут приводить к утолщению стеблей, что также препятствует полеганию. Применение регуляторов роста для укорачивания и утолщения стебля позволяет вносить большее количество удобрений для увеличения урожая, без опасности полегания зерновых культур.

Сдерживание роста растений позволяет получить более густые насаждения, так что можно получить большее количество урожая относительно земельной площади. Преимуществом в получении таких маленьких растений также является то, что сельскохозяйственную культуру можно легче обрабатывать и собирать урожай.

Благодаря этому сдерживание роста растений также может привести к повышению урожайности, потому что питательные вещества и ассимиляты в большом количестве используются для цветения и образования плодов, а не для роста вегетативных частей растения.

С помощью регуляторов роста можно часто достигнуть ускоренного вегетативного роста растений. Это используют в том случае, если собирают лишь вегетативные части растений. Ускорения роста растений может также одновременно привести к ускорению генеративного роста, благодаря образованию большего количества ассимилят, таким образом, образуется больше плодов или плоды большего размера.

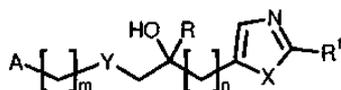
Повышения урожайности во многих случаях можно достичь при вмешательстве в обмен веществ растений, при том, что не наблюдается изменений вегетативного роста. Далее с помощью регуляторов роста можно достичь изменения состава растений, что снова может привести к улучшенному качеству продуктов урожая. Например, можно увеличить содержание сахара в сахарной свекле, сахарном тростнике, ананасах, а также в citrusовых плодах или повысить содержание белка в сое или зерновых культурах. Например, с помощью регуляторов роста также можно препятствовать снижению желаемых составных частей перед или после сбора урожая, как, например, сахара в сахарной свекле или сахарном тростнике. Кроме того, может положительно влиять на производство или отток вторичных компонентов растений. В качестве примера должна быть названа стимуляция вытекания латекса.

Под влиянием регуляторов роста можно получить бессемянные фрукты. Далее можно влиять на пол цветка. Также можно способствовать стерильности цветочной пыльцы, что имеет большое значение при выращивании и получении гибридных семян.

Применяя регуляторы роста можно регулировать ветвление растений. С одной стороны, с помощью прерывания апикального доминирования можно способствовать развитию боковых побегов, что также особенно желательно в декоративном цветоводстве в сочетании с остановкой роста. С другой стороны, также можно сдерживать рост боковых побегов. Это качество имеет большое значение, например, при разведении табака или в посадках томатов.

Под влиянием регуляторов роста можно регулировать количество листьев таким образом, чтобы растения могли их сбрасывать в необходимый момент времени. Такое опадание листьев играет большую роль при механическом сборе урожая хлопка, также и в других культурах, как, например, при разведении винограда для облегчения сбора урожая. Опадание листьев растений также можно проводить с целью снижения транспирации растений перед пересадкой.

Таким же образом, регуляторами роста можно управлять опаданием плодов. С одной стороны, можно препятствовать преждевременному опаданию плодов. С другой стороны, опадание плодов или даже опадание цветков до необходимого количества может быть необходимо ("прореживание"), чтобы прервать чередование. Под чередованием понимают особенность некоторых видов фруктов, каждый год приносить различный урожай. Наконец возможно, с помощью регуляторов роста в момент сбора урожая снизить усилия, необходимые для сбора фруктов, что способствует механическому сбору урожая или облегчает сбор урожая вручную.



(I)

№	X	Y	m	n	R	R ^t	A	Физические данные
1	S	O	0	0	<i>t</i> Bu	H	2-фтор-4-иодфенил	¹ H ЯМР: δ (400 MHz, DMSO-d ₆) = 0.98 (s, 9H), 4.25 (d, J = 10 Hz, 1H), 4.40 (d, J = 10 Hz, 1H), 5.75 (s, 1H), 7.07 (m, 1H), 7.47 (m, 1H), 7.57 (m, 1H), 7.76 (s, 1H), 8.93 (s, 1H) ppm.
2	S	O	0	0	<i>t</i> Bu	H	4-бром-2-хлорфенил	¹ H ЯМР: δ (400 MHz, DMSO-d ₆) = 0.97 (s, 9H), 4.25 (d, J = 10 Hz, 1H), 4.38 (d, J = 10 Hz, 1H), 5.69 (s, 1H), 7.17 (d, J = 9 Hz, 1H), 7.48 (dd, J = 9 Hz, 2H, 1H), 7.63 (d, J = 2 Hz, 1H), 7.81 (s, 1H), 8.92 (s, 1H) ppm.
3	S	O	0	0	<i>t</i> Bu	H	4-бром-2-фторфенил	¹ H ЯМР: δ (400 MHz, DMSO-d ₆) = 0.98 (s, 9H), 4.26 (d, J = 10 Hz, 1H), 4.41 (d, J = 10 Hz, 1H), 5.73 (s, 1H), 7.22 (m, 1H), 7.31 (m, 1H), 7.47 (m, 1H), 7.76 (s, 1H), 8.92 (s, 1H) ppm.
4	S	O	0	0	<i>t</i> Bu	H	4-хлор-2-(метилсульфанил)фенил	¹ H ЯМР: δ (400 MHz, DMSO-d ₆) = 1.00 (s, 9H), 2.34 (s, 3H), 4.18 (d, J = 10 Hz, 1H), 4.37 (d, J = 10 Hz, 1H), 5.60 (s, 1H), 7.01 (d, J = 2 Hz, 1H), 7.08 (m, 1H), 7.14 (m, 1H), 7.86 (s, 1H), 8.92 (s, 1H) ppm.
5	S	O	0	0	<i>t</i> Bu	H	2-хлор-4-иодфенил	logP 4,14 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 438.
6	S	O	0	0	<i>i</i> Pr	H	4-бром-2-фторфенил	¹ H ЯМР: δ (400 MHz, DMSO-d ₆) = 0.81 (d, 3H), 0.90 (d, 3H), 2.27 (septet, 1H), 4.15 (d, 1H), 4.22 (d, 1H), 5.80 (s, 1H), 7.18 (t, 1H), 7.29-7.35 (m, 1H), 7.51 (dd, 1H), 7.78 (s, 1H), 8.95 (s, 1H) ppm;
7	S	O	0	0	MCP	H	3,5-дибромфенил	logP 4,03 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 434
8	S	O	0	0	<i>i</i> Pr	H	4-бром-2-хлорфенил	¹ H ЯМР: δ (400 MHz, DMSO-d ₆) = 0.81 (d, 3H), 0.91 (d, 3H), 2.36 (septet, 1H), 4.13 (d, 1H), 4.19 (d, 1H), 5.80 (s, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.47 (dd, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.82 (s, 1H), 8.94 (s, 1H) ppm;
9	S	O	0	0	<i>i</i> Pr	H	4-хлор-2-(метилсульфанил)фенил	¹ H ЯМР: δ (400 MHz, DMSO-d ₆) = 0.80 (d, 3H), 0.91 (d, 3H), 2.38 (septet, 1H), 2.41 (s, 3H), 4.05 (d, 1H), 4.13 (d, 1H), 5.75 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.08-7.13 (m, 2H), 7.85 (s, 1H), 8.93 (s, 1H) ppm;
10	S	O	0	0	MCP	H	4-иод-2-метилфенил	logP 3,88 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 416
11	S	O	0	0	MCP	H	4-бром-3-хлорфенил	¹ H ЯМР: δ (400 MHz, DMSO-d ₆) = 0.1-0.18 (m, 1H), 0.28-0.38 (m, 1H), 0.85-0.95 (m, 1H), 0.95 (s, 3H), 0.95-1.03 (m, 1H), 4.28 (d, 1H), 4.49 (d, 1H), 5.70 (s, 1H), 6.96 (dd, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.85 (s, 1H), 8.98 (s, 1H) ppm
12	S	O	0	0	MCP	H	4-бром-3-фторфенил	logP 3,30 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 372, 374
13	S	O	0	0	MCP	H	4-бром-3-(трифторметил)фенил	logP 3,70 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 422, 424
14	S	O	0	0	<i>t</i> Bu	H	2-Метокси-4-(трифторметокси)фенил	logP 3,70 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 392.
15	S	O	0	0	MCP	H	4-иод-3-нитрофенил	logP 3,11 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 447
16	S	O	0	0	<i>t</i> Bu	H	3-фтор-4-((трифторметил)сульфанил)фенил	logP 3,96 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 396.
17	S	O	0	0	<i>t</i> Bu	H	3-метил-4-(метилсульфонил)фенил	logP 2,21 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 370.
18	S	O	0	0	<i>t</i> Bu	H	3-метил-4-(метилсульфинил)фенил	logP 1,90 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 354.

19	S	O	0	0	tBu	H	2-метил-4-[(трифторметил)-сульфонил]фенил	logP 3,63 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 424.
20	S	O	0	0	tBu	H	2-метокси-4-[(трифторметил)-сульфонил]фенил	logP 3,37 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 440.
21	S	O	0	0	tBu	H	3-хлор-4-[(трифторметил)-сульфонил]фенил	logP 4,31 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 412.
22	S	O	0	0	tBu	H	3-метил-4-[(трифторметил)-сульфонил]фенил	logP 4,35 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 392.
23	S	O	0	0	tBu	H	2-метил-4-[(трифторметил)-сульфонил]фенил	logP 4,43 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 392.
24	S	O	0	0	tBu	H	3-хлор-4-(трифторметокси)фенил	logP 4,02 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 396.
25	S	O	0	0	tBu	H	4-хлор-2-метилфенил	logP 3,77 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 326.
26	S	O	0	0	tBu	H	4-хлор-2-фторфенил	logP 3,37 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 330.
27	S	O	0	0	tBu	H	4-хлор-3-метилфенил	logP 3,74 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 326.
28	S	O	0	0	tBu	H	3-Метил-4-(метилсульфонил)фенил	logP 3,63 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 338.
29	S	O	0	0	tBu	H	2-хлор-4-(трифторметокси)фенил	logP 4,10 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 396.
30	S	O	0	0	tBu	H	3-хлорбифенил-4-ил	¹ H ЯМР: δ (400 MHz, DMSO-d6) = 1.04 (s, 9H), 4.29 (d, J = 10 Hz, 1H), 4.43 (d, J = 10 Hz, 1H), 5.73 (s, 1H), 7.27 (d, J = 9Hz, 1H), 7.34 (m, 1H), 7.44 (m, 2H), 7.61 (m, 3H), 7.71 (d, J = 2Hz, 1H), 7.87 (s, 1H), 8.94 (s, 1H) ppm.
31	S	-	0	0	tBu	H	2,4-дифторфенил	logP 3,04 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 298.
32	S	O	0	0	MCP	H	4-бром-2-фторфенил	logP 3,32 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 372, 374
33	S	O	0	0	tBu	H	2,4-дифторфенил	logP 3,84 ^[a]
34	S	O	0	0	tBu	H	2,4-дифторфенил	logP 2,98 ^[a]
35	S	O	0	0	MCP	H	4-бром-2-метоксифенил	logP 3,26 ^[a]
36	S	O	0	0	MCP	H	4-бром-3-метоксифенил	logP 3,16 ^[a]
37	S	O	0	0	tBu	H	4-хлор-2-(трифторметил)фенил	logP 3,96 ^[a]
38	S	O	0	0	TFCP	H	2-фтор-4-иодфенил	
39	S	O	0	0	tBu	H	3,4-дихлорфенил	logP 3,72 ^[a]
40	S	O	0	0	TFCP	H	4-бром-2-метилфенил	
41	S	O	0	0	tBu	H	3-бром-4-(трифторметокси)фенил	logP 4,12 ^[a]
42	S	O	0	0	tBu	H	2-метил-4-(трифторметокси)фенил	logP 4,12 ^[a]
43	S	-	0	1	CCP	Cl	2,4-дихлорфенил	

iPr = изопропил, tBu = трет-бутил, DFMP = 1,3-дифтор-2-метилпропан-2-ил, CCP = 1-хлорциклопропил, FCP = 1-фторциклопропил, MCP = 1-метилциклопропил, TFCP = 1-(трифторметил)циклопропил, CCP = 1-хлорциклопропил.

Определение величины logP осуществляли согласно EEC Directive 79/831 Annex V.A8 ВЭЖХ (высокоэффективной жидкостной хроматографией) на колонке с обращенной фазой (C 18), следующим способом.

[a] Определение ЖХ/МС (жидкостной хроматографии и масс-спектрометрии) в кислотной области осуществляли при pH 2,7 с 0,1% водной муравьиной кислотой и ацетонитрилом (с содержанием муравьиной кислоты 0,1%) в виде элюентов, линейный градиент ацетонитрил 10-95%.

Другие данные ЯМР выбранных примеров в виде пиковых списков ¹H-ЯМР

Данные ¹H-ЯМР следующих выбранных примеров отметили в виде пиковых списков ¹H-ЯМР. К каждому сигнальному пику сначала приводят δ-величину в частях на миллион, затем интенсивность сигнала в скобках и отделяют знаком пропуска. Пара данных δ-величина-интенсивность сигнала различных сигнальных пиков отделена друг от друга точкой с запятой. Поэтому пиковый список примера имеет следующую форму:

δ₁ (интенсивность₁); δ₂ (интенсивность₂);; δ_i (интенсивность_i);; δ_n

(интенсивность_n)

Растворитель, который использовали в спектре ЯМР, указан в квадратных скобках за номером примера и перед пиковым списком ЯМР. Подробное описание изложения данных ЯМР в виде пиковых списков можно найти в публикации "Citation of ЯМР Peaklist Data within Patent Applications" (см. Research Disclosure Database Number 564025, 2011, 16 марта 2011 или <http://www.rdelectronic.co.uk/rd/free/RD564025.pdf>).

<p>Пример 33 [DMSO-D6] 8.9252 (1.70); 7.8174 (1.99); 7.5363 (1.28); 7.5299 (1.35); 7.3763 (0.66); 7.3698 (0.61); 7.3541 (0.91); 7.3476 (0.85); 7.2447 (1.41); 7.2224 (1.01); 5.7075 (2.38); 4.4053 (0.78); 4.3804 (1.08); 4.2752 (1.06); 4.2503 (0.77); 3.3076 (15.73); 2.5109 (2.04); 2.5066 (3.68); 2.5022 (4.70); 2.4978 (3.29); 2.4935 (1.59); 1.0097 (16.00); 0.9766 (0.32); -0.0002 (0.55)</p>
<p>Пример 34 [DMSO-D6] 8.9306 (1.68); 7.7749 (1.98); 7.7738 (1.88); 7.2648 (0.56); 7.2549 (0.60); 7.2413 (0.68); 7.2360 (0.69); 7.2296 (0.52); 7.2170 (0.39); 7.2146 (0.39); 7.2067 (0.32); 6.9955 (0.36); 6.9931 (0.39); 5.7292 (2.49); 4.4182 (0.81); 4.3934 (1.05); 4.2526 (1.04); 4.2278 (0.80); 3.3064 (20.14); 2.5101 (2.51); 2.5059 (4.55); 2.5014 (5.86); 2.4971 (4.15); 2.4928 (2.04); 2.0856 (0.98); 0.9834 (16.00)</p>
<p>Пример 35 [DMSO-D6] 8.8319 (0.91); 8.8306 (0.83); 7.7553 (1.08); 7.7539 (0.98); 7.0090 (0.61); 7.0042 (0.65); 6.9249 (0.70); 6.9199 (0.72); 6.9139 (1.00); 5.4730 (0.53); 4.2354 (0.44); 4.2106 (0.56); 4.0778 (0.55); 4.0530 (0.43); 3.6439 (3.78); 3.1747 (16.00); 2.3756 (1.80); 2.3714 (3.19); 2.3669 (4.02); 2.3626 (2.79); 2.3583 (1.34); 1.2644 (2.79); 0.8283 (2.72)</p>
<p>Пример 38 [DMSO-D6] 9.0525 (1.82); 9.0512 (1.78); 7.9899 (1.92); 7.6233 (0.67); 7.6182 (0.70); 7.5966 (0.67); 7.5915 (0.71); 7.5079 (0.42); 7.5043 (0.52); 7.4865 (0.48); 7.4828 (0.58); 7.4782 (0.42); 7.1953 (0.57); 7.1732 (1.01); 7.1511 (0.51); 6.4388 (2.18); 4.5935 (0.42); 4.5675 (1.05); 4.5406 (0.99); 4.5145 (0.37); 3.3034 (161.71); 2.8902 (0.40); 2.7307 (0.34); 2.6690 (0.34); 2.5391 (0.82); 2.5088 (19.00); 2.5044 (34.29); 2.5000 (43.96); 2.4956 (30.41); 2.4912 (14.67); 1.9867 (0.64); 1.4345 (0.36); 1.3984 (16.00); 1.1749 (0.41); 1.0343 (0.40); 1.0215 (0.36); 1.0176 (0.36); 0.9072 (0.35); 0.9023 (0.35); 0.8941 (0.33); 0.8901 (0.40); -0.0002 (2.98)</p>
<p>Пример 39 [DMSO-D6] 8.9293 (1.66); 8.9252 (1.50); 7.7499 (2.01); 7.7460 (1.81); 7.4968 (1.06); 7.4912 (1.04); 7.4745 (1.14); 7.4689 (1.09); 7.2936 (1.19); 7.2878 (1.73); 7.2812 (1.10); 6.9625 (0.67); 6.9567 (0.95); 6.9498 (0.63); 6.9402 (0.64); 6.9343 (0.87); 6.9274 (0.54); 5.7478 (2.18); 5.7423 (2.10); 4.4855 (0.85); 4.4811 (0.79); 4.4606 (1.02); 4.4563 (0.92); 4.2260 (1.00); 4.2216 (0.93); 4.2012 (0.86); 4.1966 (0.78); 3.3176 (23.07); 3.3121 (23.19); 2.5070 (8.01); 2.5028 (7.25); 1.4032 (6.86); 1.3977 (6.63); 0.9815 (16.00); 0.9767 (15.10); 0.0056 (0.33); -0.0002 (0.34)</p>
<p>Пример 40 [DMSO-D6] 9.0508 (0.67); 8.0110 (0.71); 7.3414 (0.77); 7.3223 (0.35); 6.3728 (0.86); 5.7461 (16.00); 3.4276 (0.38); 3.3103 (878.85); 3.2874 (8.38); 3.1792 (0.41); 2.6738 (0.79); 2.6694 (1.06); 2.6650 (0.82); 2.5393 (2.27); 2.5090 (57.98); 2.5048 (103.51); 2.5004 (131.54); 2.4960 (92.07); 2.4918 (44.88); 2.3315 (0.71); 2.3270 (0.91); 2.3223 (0.65); 2.1489 (1.89); -0.0002 (20.21); -0.0084 (0.67)</p>
<p>Пример 41 [DMSO-D6] 8.9346 (1.09); 7.7564 (1.50); 7.4376 (1.43); 7.4302 (1.65); 7.4267 (0.74); 7.4233 (0.68); 7.4037 (0.67); 7.4006 (0.68); 7.0487 (0.80); 7.0413 (0.77); 7.0260 (0.72); 7.0185 (0.71);</p>

5.7665 (1.41); 4.5124 (0.83); 4.4875 (0.98); 4.2367 (0.96); 4.2117 (0.84); 3.3287 (8.45); 2.5106 (4.28); 2.5065 (8.31); 2.5022 (11.54); 2.4980 (8.03); 2.4938 (4.03); 0.9767 (16.00); -0.0002 (3.34)
Пример 42 [DMSO-D6] 8.9289 (1.63); 7.7418 (1.67); 7.1351 (0.39); 7.1130 (1.59); 7.0806 (1.15); 7.0598 (0.62); 5.7043 (2.43); 4.3361 (0.60); 4.3111 (1.15); 4.2759 (1.17); 4.2515 (0.63); 3.3230 (186.57); 3.3183 (185.48); 3.2963 (2.14); 2.6791 (0.65); 2.6748 (1.23); 2.6699 (1.77); 2.6658 (1.28); 2.5403 (2.60); 2.5233 (2.96); 2.5052 (190.70); 2.5011 (256.80); 2.4975 (177.76); 2.4670 (0.52); 2.3370 (0.65); 2.3324 (1.32); 2.3277 (1.67); 2.3232 (1.28); 1.9428 (5.19); 1.3353 (0.32); 1.2981 (0.34); 1.2589 (0.48); 1.2435 (0.53); 1.2354 (0.74); 1.0053 (16.00); 0.9754 (0.47); 0.9552 (0.33); 0.9115 (0.42); 0.8852 (1.24); 0.8412 (0.85); 0.1457 (0.33); 0.0080 (2.35); -0.0002 (85.85); -0.0085 (2.63); -0.1498 (0.38)
Пример 43 [DMSO-D6] 7.6729 (0.36); 7.6694 (0.37); 7.5753 (0.40); 7.5616 (2.54); 7.5578 (4.26); 7.5434 (2.41); 7.4583 (3.60); 7.4418 (0.57); 7.4379 (0.32); 7.4032 (1.47); 7.3995 (1.41); 7.3893 (1.26); 7.3856 (1.21); 6.7796 (0.55); 5.9223 (0.32); 5.9136 (0.35); 5.3362 (0.34); 5.2956 (3.46); 5.1833 (0.33); 5.1144 (0.36); 4.0600 (0.54); 4.0517 (0.54); 3.4593 (1.60); 3.4360 (1.76); 3.4159 (1.33); 3.3910 (1.46); 3.3496 (50.10); 3.0106 (1.61); 2.9872 (1.44); 2.8750 (1.35); 2.8500 (1.25); 2.5251 (0.35); 2.5220 (0.44); 2.5189 (0.51); 2.5098 (9.60); 2.5070 (19.67); 2.5041 (26.50); 2.5011 (19.54); 2.4983 (9.39); 1.3967 (16.00); 1.3859 (0.69); 1.2709 (0.42); 1.2679 (0.40); 0.9610 (0.38); 0.9586 (0.41); 0.9525 (0.66); 0.9433 (0.66); 0.9408 (0.75); 0.9323 (0.64); 0.9171 (0.60); 0.9087 (0.71); 0.9066 (0.75); 0.8977 (0.72); 0.8911 (0.36); 0.8886 (0.42); 0.8798 (0.36); 0.7468 (0.40); 0.7374 (0.51); 0.7356 (0.52); 0.7284 (0.79); 0.7196 (0.67); 0.7178 (0.70); 0.7092 (0.46); 0.6315 (0.49); 0.6233 (0.60); 0.6205 (0.61); 0.6141 (0.61); 0.6124 (0.65); 0.6056 (0.45); 0.6026 (0.48); 0.5938 (0.33); -0.0002 (1.48)

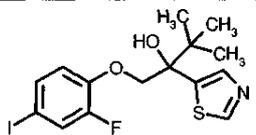
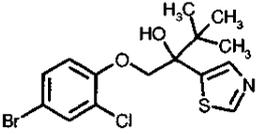
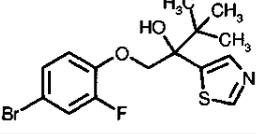
Примеры применения

Пример А. Испытание *Blumeria graminis* (ячмень)/защита.

Растворитель: 49 мас.ч. N,N-диметилацетамида.

Эмульгатор: 1 мас.ч. эфира алкиларилполигликоля.

При изготовлении данного активного действующего раствора перемешивается 1 мас.ч. активного действующего вещества с указанным количеством растворителя и эмульгатора и концентрат разбавляется водой до желаемой концентрации. Для проверки защитного действия молодые растения опрыскивают препаратом биологически активного вещества в указанном применяемом количестве. После подсыхания нанесенного слоя растения опыляют спорами *Blumeria graminis* f.sp. *hordei*. Растения помещают в теплицу с температурой примерно 18°C и относительной влажностью воздуха примерно 80%, что благоприятно влияет на развитие пустул мучнистой росы. Через 7 дней после инокуляции следует оценка. При этом 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности контроля, тогда как эффективность 100% означает, что не наблюдается никакого поражения. В этом тесте показаны следующие соединения согласно изобретению с концентрацией биологического активного вещества 500 ч./млн и степенью эффективности 70% или более.

Испытание <i>Blumeria graminis</i> (ячмень)/защита			
№	Биологически активное вещество	Норма расхода (ч/млн)	Степень эффективности (%)
1		500	100
2		500	100
3		500	100

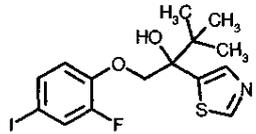
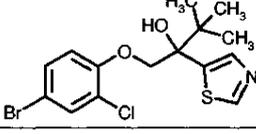
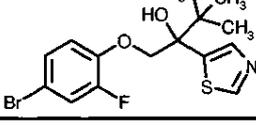
Пример В. Испытание *Leptosphaeria nodorum* (пшеница)/защита.

Растворитель: 49 мас.ч. N,N-диметилацетамида.

Эмульгатор: 1 мас.ч. эфира алкиларилполигликоля.

При изготовлении данного активного действующего раствора перемешивается 1 мас.ч. активного действующего вещества с указанным количеством растворителя и эмульгатора и концентрат разбавляется водой до желаемой концентрации. Для проверки защитного действия молодые растения опрыскивают препаратом биологически активного вещества в указанном применяемом количестве. После подсыхания нанесенного раствора растения опыляют спорами споровой суспензии *Leptosphaeria nodorum*. Растения оставляют на 48 ч при температуре 20°C и относительной влажности 100% в инкубационной кабине. Растения помещают в теплицу с температурой примерно 22°C и относительной влажностью воздуха примерно 80%. Через 8 дней после инокуляции следует оценка. При этом 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности контроля, тогда как эффективность 100% означает, что не наблюдается никакого поражения. В этом тесте показаны следующие соединения согласно изобретению с концентрацией биологического активного вещества 500 ч./млн и степенью эффективности 70% или более.

Таблица В

Испытание <i>Leptosphaeria nodorum</i> (пшеница)/защита			
№	Биологически активное вещество	Норма расхода (ч/млн)	Степень эффективности (%)
1		500	100
2		500	92
3		500	100

Пример С. Испытание *Puccinia triticina* (пшеница)/защита.

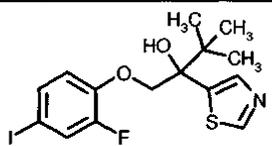
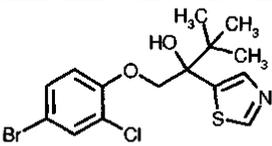
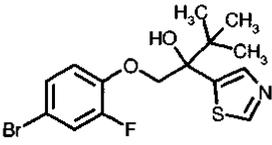
Растворитель: 49 мас.ч. N,N-диметилацетамида.

Эмульгатор: 1 мас.ч. эфира алкиларилполигликоля.

При изготовлении данного активного действующего раствора перемешивают 1 мас.ч. активного действующего вещества с указанным количеством растворителя и эмульгатора и концентрат разбавляют

водой до желаемой концентрации. Для проверки защитного действия молодые растения опрыскивают препаратом биологически активного вещества в указанном применяемом количестве. После подсыхания нанесенного раствора растения опыляют спорами споровой суспензии *Puccinia triticina*. Растения оставляют на 48 ч при температуре 20°C и относительной влажности 100% в инкубационной кабине. Растения помещают в теплицу с температурой примерно 20°C и относительной влажностью воздуха примерно 80%. Через 8 дней после инокуляции следует оценка. При этом 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности контроля, тогда как эффективность 100% означает, что не наблюдается никакого поражения. В этом тесте показаны следующие соединения согласно изобретению с концентрацией биологического активного вещества 500 ч./млн и степенью эффективности 70% или более.

Таблица С

Испытание <i>Puccinia triticina</i> (пшеница)/защита			
№	Биологически активное вещество	Норма расхода (ч./млн)	Степень эффективности (%)
1		500	100
2		500	95
3		500	100

Пример D. Испытание *Uromyces* (фасоль)/защита.

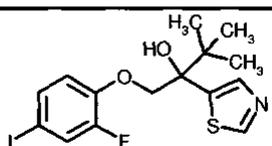
Растворитель: 24,5 мас.ч. ацетона.

24,5 мас.ч. диметилацетамида.

Эмульгатор: 1 мас.ч. эфира алкил-арил-полигликоля.

При изготовлении данного активного действующего раствора перемешивают 1 мас.ч. активного действующего вещества с указанным количеством растворителя и эмульгатора и концентрат разбавляют водой до желаемой концентрации. Для проверки защитного действия молодые растения опрыскивают препаратом биологически активного вещества в указанном применяемом количестве. После подсыхания нанесенного слоя растения инокулируют водной суспензией конидий возбудителя ржавчины фасоли *Uromyces arpendiculatus* и затем оставляют на 1 день при температуре примерно 20°C и относительной влажности воздуха 100% в инкубационной кабине. Затем растения помещают в теплицу с температурой примерно 21°C и относительной влажностью воздуха примерно 90%. Через 10 дней после инокуляции производят оценку. При этом 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности контроля, тогда как эффективность 100% означает, что не наблюдается никакого поражения. В этом тесте показаны следующие соединения согласно изобретению с концентрацией биологического активного вещества 100 ч./млн и степенью эффективности 70% или более.

Таблица D

Испытание <i>Uromyces</i> (фасоль)/защита			
№	Биологически активное вещество	Норма расхода (ч./млн)	Степень эффективности (%)
1		100	100

Пример E. Испытание *Venturia* (яблоко)/защита.

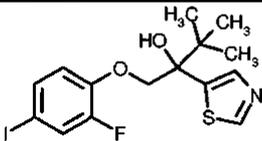
Растворитель: 24,5 мас.ч. ацетона.

24,5 мас.ч. диметилацетамида.

Эмульгатор: 1 мас.ч. эфира алкил-арил-полигликоля.

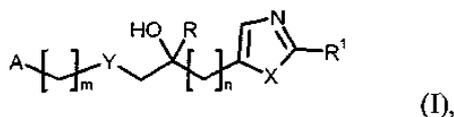
При изготовлении данного активного действующего раствора перемешивают 1 мас.ч. активного действующего вещества с указанным количеством растворителя и эмульгатора и концентрат разбавляют водой до желаемой концентрации. Для проверки защитного действия молодые растения опрыскивают препаратом биологически активного вещества в указанном применяемом количестве. После подсыхания нанесенного слоя растения инокулируют водной суспензией конидий возбудителя парши яблони *Venturia inaequalis* и затем оставляют на 1 день при температуре примерно 20°C и относительной влажности воздуха 100% в инкубационной кабине. Затем растения помещают в теплицу с температурой примерно 21°C и относительной влажностью воздуха примерно 90%. Через 10 дней после инокуляции производят оценку. При этом 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности контроля, тогда как эффективность 100% означает, что не наблюдается никакого поражения. В этом тесте показаны следующие соединения согласно изобретению с концентрацией биологического активного вещества 100 ч./млн и степенью эффективности 70% или более.

Таблица Е

Испытание <i>Venturia</i> (яблоко)/защита			
№	Биологически активное вещество	Норма расхода (ч./млн)	Степень эффективности (%)
1		100	97

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Гетероциклические производные алканола формулы (I)



в которой

X означает S,

Y означает O, -CH₂- или прямую связь,

m означает 0 или 1,

n означает 0 или 1,

R означает соответственно, при необходимости, разветвленный C₃-C₇-алкил, C₁-C₈-галогеналкил, C₂-C₇-алкенил, C₂-C₇-галогеналкенил, замещенный при необходимости галогеном, C₁-C₄-алкилом, C₁-C₄-галоалкилом, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галоалкокси, C₁-C₄-галоалкилтио или C₁-C₄-алкилтио C₃-C₇-циклоалкил, а также при необходимости замещенный от одного до трех раз галогеном или C₁-C₄-алкилом фенил,

R¹ означает водород или галоген,

A означает соответственно фенил, двукратно замещенный Z, причем оба заместителя Z могут быть одинаковыми или различными,

Z означает галоген, циано, нитро, OH, SH, C(C₁-C₅-алкил)(=NO(C₁-C₅алкил)), C₃-C₇-циклоалкил, C₁-C₄-алкил, C₁-C₄-галогеналкил, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкокси, C₁-C₄-алкилтио, C₁-C₄-галогеналкилтио, C₂-C₄-алкенил, C₂-C₄-галогеналкенил, C₂-C₄-алкинил, C₂-C₄-галогеналкинил, C₁-C₄-алкилсульфинил, C₁-C₄-галогеналкилсульфинил, C₁-C₄-алкилсульфонил, C₁-C₄-галогеналкилсульфонил, формил, C₂-C₅-алкилкарбонил, C₂-C₅-галогеналкилкарбонил, C₂-C₅-алкоксикарбонил, C₂-C₅-галогеналкоксикарбонил, C₃-C₆-алкенилокси, C₃-C₆-алкинилокси, C₂-C₅-алкилкарбонилокси, C₂-C₅-галогеналкилкарбонилокси, триалкилсилил или, соответственно, при необходимости однократно замещенные галогеном, C₁-C₄-алкилом, C₁-C₄-галогеналкилом, C₁-C₄-алкокси или C₂-C₄-алкилкарбонилем фенил, фенокси или фенилтио,

а также их агрохимически активные соли.

2. Гетероциклические производные алканола формулы (I) по п.1, в которой

X означает S,

Y означает O, -CH₂- или прямую связь,

m означает 0 или 1,

n означает 0 или 1,

R означает соответственно, при необходимости, разветвленный C₃-C₅-алкил, C₁-C₆-галогеналкил, C₃-C₅-алкенил, C₃-C₅-галогеналкенил, при необходимости замещенный галогеном, C₁-C₄-алкилом, C₁-C₄-галоалкилом, C₁-C₄-галоалкокси, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галоалкилтио или C₁-C₄-алкилтио C₃-C₆-циклоалкил,

R¹ означает водород или галоген,

A означает соответственно фенил, двукратно замещенные Z, причем оба заместителя Z могут быть одинаковыми или различными,

Z означает галоген, циано, нитро, C(C₁-C₅-алкил)(=NO(C₁-C₅-алкил)), C₃-C₆-циклоалкил, C₁-C₄-алкил, C₁-C₄-галогеналкил, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкокси, C₁-C₄-алкилтио, C₁-C₄-галогеналкилтио, C₂-C₄-алкенил, C₂-C₄-алкинил, C₁-C₄-алкилсульфинил, C₁-C₄-алкилсульфонил, C₂-C₅-алкилкарбонил, C₂-C₅-алкоксикарбонил, C₃-C₆-алкенилокси, C₃-C₆-алкинилокси, C₂-C₅-алкилкарбонилокси или, соответственно, при необходимости однократно замещенный галогеном, C₁-C₄-алкилом, C₁-C₄-галогеналкилом, C₁-C₄-алкокси или C₂-C₄-алкилкарбонилом фенил, фенокси или фенилтио.

3. Способ борьбы с фитопатогенными грибами, отличающийся тем, что гетероциклические производные алканола формулы (I) по п.1 или 2 наносят на фитопатогенные грибы и/или их среду обитания.

4. Средство для борьбы с фитопатогенными грибами, отличающееся содержанием по меньшей мере одного гетероциклического производного алканола формулы (I) по п.1 или 2 наряду с наполнителями и/или поверхностно-активными веществами.

5. Средство по п.4, содержащее по меньшей мере одно дополнительное биологически активное вещество, выбранное из группы инсектицидов, аттрактантов, стерилиантов, бактерицидов, акарицидов, нематодицидов, фунгицидов, регуляторов роста, гербицидов, удобрений, защитных средств и семиохимикалий.

6. Применение гетероциклических производных алканола формулы (I) по п.1 или 2 для борьбы с фитопатогенными грибами.

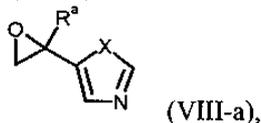
7. Применение гетероциклических производных алканола формулы (I) по п.1 или 2 в качестве регуляторов роста растений.

8. Способ получения средств для борьбы с фитопатогенными грибами, отличающийся тем, что гетероциклические производные алканола формулы (I) по п.1 или 2 смешивают с наполнителями и/или поверхностно-активными веществами.

9. Применение гетероциклических производных алканола формулы (I) по п.1 для обработки трансгенных растений.

10. Применение гетероциклических производных алканола формулы (I) по п.1 для обработки семян, а также семян трансгенных растений.

11. Производные оксирана формулы (VIII-a)



в которой

X означает S,

R^a означает при необходимости разветвленный C₃-C₇-алкил (за исключением трет-бутила, если X означает S), C₁-C₈-галогеналкил, C₂-C₇-алкенил, C₂-C₇-галогеналкенил, замещенный при необходимости галогеном, C₁-C₄-алкилом, C₁-C₄-галоалкилом, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галоалкокси, C₁-C₄-галоалкилтио или C₁-C₄-алкилтио, C₃-C₇-циклоалкил, а также при необходимости замещенный от одного до трех раз галогеном или C₁-C₄-алкилом фенил.

