



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 110705

(13) C2

(51) МПК

C07D 277/24 (2006.01)

C07D 417/04 (2006.01)

A01N 43/78 (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки:	а 2012 14989	(72) Винахідник(и):	Нізінг Карл Фрідріх (DE), Хельмке Хендрік (DE), Крісто П'єр (FR), Періс Горка (ES/DE), Цучія Томокі (JP/DE), Васнер П'єр (BE/DE), Бентінг Юрген (DE)
(22) Дата подання заявки:	24.05.2011	(73) Власник(и):	БАСР ІНТЕЛЛЕКЧУЕЛ ПРОПЕРТІ ГМБХ, Alfred-Nobel-Str. 10, 40789 Monheim, Germany (DE)
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід:	10.02.2016	(74) Представник:	Шамріна Олена Олексіївна, реєстр. №141
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	10164143.9, 61/350,522	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	EP0409418, A1, 23.01.1991 EP0395175, A2, 31.10.1990
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	27.05.2010, 02.06.2010		
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	EP, US		
(41) Публікація відомостей про заявку:	11.02.2013, Бюл.№ 3		
(46) Публікація відомостей про видачу патенту:	10.02.2016, Бюл.№ 3		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	PCT/EP2011/058442, 24.05.2011		

(54) НОВІ ГЕТЕРОЦИКЛІЧНІ ПОХІДНІ АЛКАНОЛІВ

(57) Реферат:

Винахід належить до нових гетероциклічних похідних алканолів, способу одержання цих сполук, засобів, що містять ці сполуки, а також їх застосування як біологічно активних сполук, зокрема для боротьби із шкідливими мікроорганізмами у галузі захисту рослин і матеріалів.

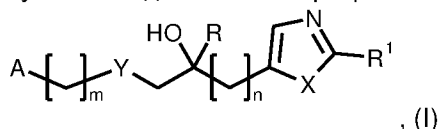
UA 110705 C2

Винахід стосується нових гетероциклічних похідних алканолів, способу одержання цих сполук, засобів, що містять ці сполуки, а також їх застосування як біологічно активних сполук, зокрема для боротьби зі шкідливими мікроорганізмами в галузі захисту рослин і матеріалів, а також як регуляторів росту рослин.

Уже відомо, що певні гетероциклічні похідні алканолів можуть бути застосовані в галузі захисту рослин як фунгіциди та/або регулятори росту (див. публікації EP-A 0 395 175, EP-A 0 409 418).

Оскільки екологічні та економічні вимоги до сучасних активних речовин, наприклад фунгіцидів, постійно зростають, наприклад щодо спектра дії, токсичності, селективності, норми витрати, утворення осаду і зручності виготовлення, а також можуть виникати, наприклад, проблеми, пов'язані з резистентністю, завжди існує потреба у розробленні нових фунгіцидних засобів, які принаймні за деякими параметрами краще відповідали б вищенаведеним вимогам.

Були винайдені нові гетероциклічні похідні алканолів формули (I)



в якій
X означає O або S,
Y означає O, -CH₂- або прямий зв'язок,
m означає 0 або 1,
n означає 0 або 1,

R означає в кожному випадку необов'язково заміщений алкіл, алкеніл, циклоалкіл або арил,
R¹ означає водень, SH, алкілтіо, алкокси, галоген, галогеналкіл, галогеналкілтіо, галогеналкокси, ціано, нітро або Si(алкіл)₃,

A означає в кожному випадку тризаміщений Z феніл або нафтил, причому обидва замісники Z є однаковими або різними,

Z означає галоген, ціано, нітро, OH, SH, C(алкіл)(=NOалкіл), C₃-C₇-циклоалкіл, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкокси, C₁-C₄-алкілтіо, C₁-C₄-галогеналкілтіо, C₂-C₄-алкеніл, C₂-C₄-галогеналкеніл, C₂-C₄-алкініл, C₂-C₄-галогеналкініл, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галогеналкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл, форміл, C₂-C₅-алкілкарбоніл, C₂-C₅-галогеналкілкарбоніл, C₂-C₅-алкоксикарбоніл, C₂-C₅-галогеналкоксикарбоніл, C₃-C₆-алкенілокси, C₃-C₆-алкінілокси, C₂-C₅-алкілкарбонілокси, C₂-C₅-галогеналкілкарбонілокси, триалкілсиліл, або означає в кожному випадку необов'язково монозаміщений галогеном, C₁-C₄-алкілом, C₁-C₄-галогеналкілом, C₁-C₄-алкокси або C₂-C₄-алкілкарбонілом феніл, фенокси або фенілтіо, а також їх агрохімічно активні солі.

Одержані таким чином солі також мають фунгіцидні та/або регулюючі ріст рослин властивості.

Придатні до застосування згідно з винаходом гетероциклічні похідні алканолів в загальному випадку визначені формулою (I). Переважні значення залишків у попередніх та наступних формулах наведені далі. Ці значення рівною мірою стосуються кінцевих продуктів формули (I), а також всіх проміжних продуктів (див. також "Пояснення способу і проміжних продуктів").

X означає переважно S.

X означає також переважно O.

Y означає переважно O.

Y означає також переважно -CH₂-.

Y означає також переважно прямий зв'язок.

Y означає особливо переважно O.

Y означає також особливо переважно -CH₂-.

m означає переважно 0.

m означає також переважно 1.

n означає переважно 0.

n означає також переважно 1.

R означає переважно в кожному випадку необов'язково розгалужений C₃-C₇-алкіл, C₁-C₈-галогеналкіл, C₂-C₇-алкеніл, C₂-C₇-галогеналкеніл, означає необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄-алкілом, C₁-C₄-галоалкілом, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галоалкокси, C₁-C₄-галоалкілтіо або C₁-C₄-алкілтіо C₃-C₇-циклоалкіл, а також означає необов'язково одно-тризаміщений галогеном або C₁-C₄-алкілом феніл.

R означає особливо переважно в кожному випадку необов'язково розгалужений C₃-C₅-алкіл,

C₁-C₆-галогеналкіл, C₃-C₅ алкеніл, C₃-C₅-галогеналкеніл, означає необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄-алкілом, C₁-C₄-галоалкілом, C₁-C₄-галоалкокси, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галоалкілтіо або C₁-C₄-алкілтіо C₃-C₆-циклоалкіл.

5 R означає цілком переважно трет-бутил, ізопропіл, 1-хлорциклопропіл, 1-фторциклопропіл, 1-метилциклопропіл, 1-метоксициклопропіл, 1-метилтіоциклопропіл, 1-трифторметилциклопропіл, (3E)-4-хлор-2-метилбут-3-ен-2-іл, C₁-C₄-галогеналкіл.

R¹ означає переважно водень, SH, C₁-C₄-алкілтіо, C₁-C₄-алкокси або галоген.

R¹ означає особливо переважно водень, SH, метилтіо, етилтіо, метокси, етокси, фтор, хлор, бром або йод.

10 A означає переважно тризаміщений Z феніл, причому обидва замісники Z є однаковими або різними.

A означає особливо переважно заміщений Z у 2-му, 3-му і 4-му положенні феніл, причому замісники Z є однаковими або різними.

15 A означає також особливо переважно заміщений Z у 2-му, 4-му і 6-му положенні феніл, причому замісники Z є однаковими або різними.

A означає також особливо переважно заміщений Z у 3-му, 4-му і 5-му положенні феніл, причому замісники Z є однаковими або різними.

A означає також особливо переважно заміщений Z у 2-му, 4-му і 5-му положенні феніл, причому замісники Z є однаковими або різними.

20 A означає переважно тризаміщений Z нафтил, причому замісники Z є однаковими або різними.

A означає особливо переважно тризаміщений Z 1-нафтил, причому замісники Z є однаковими або різними.

25 A означає також особливо переважно тризаміщений Z 2-нафтил, причому замісники Z є однаковими або різними.

30 Z означає переважно галоген, ціано, нітро, C(C₁-C₅-алкіл)(=NO(C₁-C₅-алкіл)), C₃-C₆-циклоалкіл, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкокси, C₁-C₄-алкілтіо, C₁-C₄-галогеналкілтіо, C₂-C₄-алкеніл, C₂-C₄-алкініл, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₂-C₅-алкілкарбоніл, C₂-C₅-алкоксикарбоніл, C₃-C₆-алкенілокси, C₃-C₆-алкінілокси, C₂-C₅-алкілкарбонілокси, або означає в кожному випадку необов'язково монозаміщений галогеном, C₁-C₄-алкілом, C₁-C₄-галогеналкілом, C₁-C₄-алкокси або C₂-C₄-алкілкарбонілом феніл, фенокси або фенілтіо.

35 Z означає особливо переважно галоген, ціано, нітро, C(C₁-C₄-алкіл)(=NO(C₁-C₄-алкіл)), C₃-C₆-циклоалкіл, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₂-галогеналкіл, C₁-C₂-алкокси, C₁-C₂-галогеналкокси, C₁-C₂-алкілтіо, C₁-C₂-галогеналкілтіо, C₁-C₂-алкіл-сульфініл, C₁-C₂-алкілсульфоніл, ацетил, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, метилкарбонілокси, або означає в кожному випадку необов'язково монозаміщений галогеном, C₁-C₂-алкілом, C₁-C₂-галогеналкілом, C₁-C₂-алкокси, ацетилом феніл, фенокси або фенілтіо.

40 Z означає цілком переважно фтор, хлор, бром, йод, ціано, нітро, CH(=NOMe), циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, метил, етил, n-пропіл, ізопропіл, n-, i-, c- або t-бутил, трифторметил, трихлорметил, дифторметил, дихлорметил, дифторхлорметил, метокси, трифторметокси, дифторметокси, метилтіо, трифторметилтіо, дифторметилтіо, або означає в кожному випадку необов'язково монозаміщений фтором, хлором, бромом, йодом, метилом, етилом, трифторметилом, трихлорметилом, дифторметилом, дихлорметилом, дифторхлорметилом, метокси, ацетилом феніл, фенокси або фенілтіо.

45 Проте, можливими є також будь-які комбінації наведених вище загальних або в переважних діапазонах значень залишків чи пояснень між собою, тобто між відповідними діапазонами і переважними діапазонами. Вони стосуються відповідно кінцевих продуктів, а також попередників і проміжних продуктів. Окрім цього, окремі визначення можуть бути виключені.

50 Переважними є такі сполуки формули (I), в якій усі залишки в кожному випадку мають наведені вище переважні значення.

Особливо переважними є такі сполуки формули (I), в якій усі залишки мають в кожному випадку наведені вище особливо переважні значення.

55 Цілком переважними є такі сполуки формули (I), в якій усі залишки мають в кожному випадку наведені вище цілком переважні значення.

Також переважними є сполуки формули (I), в якій Y означає кисень.

Також переважними є сполуки формули (I), в якій Y означає -CH₂-.

Також переважними є сполуки формули (I), в якій Y означає прямий зв'язок.

Також переважними є сполуки формули (I), в якій R означає t-бутил.

60 Також переважними є сполуки формули (I), в якій R означає 1,3-дифтор-2-метилпропан-2-іл.

Також переважними є сполуки формули (I), в якій R означає 1-метилциклопропіл.
 Також переважними є сполуки формули (I), в якій R означає 1-фторциклопропіл.
 Також переважними є сполуки формули (I), в якій R означає 1-хлорциклопропіл.
 Також переважними є сполуки формули (I), в якій R означає ізопропіл.

5 Також переважними є сполуки формули (I), в якій R означає 1-метилциклогексил.

Також переважними є сполуки формули (I), в якій $n = 0$.

Також переважними є сполуки формули (I), в якій $n = 1$.

Також переважними є сполуки формули (I), в якій X означає сірку.

Також переважними є сполуки формули (I), в якій R^1 означає водень.

10 Також переважними є сполуки формули (I), в якій R^1 означає SH.

Можливими є будь-які комбінації наведених вище значень залишків між собою. Окрім цього, окремі визначення можуть бути виключені.

Для визначення символів у попередніх формулах були використані загальні поняття, що стосуються наведених далі замісників:

15 Галоген (також у комбінаціях, таких як галогеналкіл, галогеналкокси тощо): фтор, хлор, бром і йод;

Алкіл: (також у комбінаціях, таких як алкілтіо, алкокси тощо): насичені, нерозгалужені або розгалужені вуглеводневі залишки, що містять від 1 до 8 атомів вуглецю, наприклад C_1 - C_6 -алкіл, такі як метил, етил, пропіл, 1-метилетил, бутил, 1-метилпропіл, 2-метилпропіл, 1,1-диметилетил, пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропіл, 1-етилпропіл, гексил, 1,1-диметилпропіл, 1,2-диметилпропіл, 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-етилбутил, 2-етилбутил, 1,1,2-триметилпропіл, 1,2,2-триметилпропіл, 1-етил-1-метилпропіл і 1-етил-2-метилпропіл; гептил, октил.

Галогеналкіл: (також у комбінаціях, таких як галогеналкілтіо, галогеналкокси тощо): нерозгалужені або розгалужені алкільні групи, що містять від 1 до 8 атомів вуглецю (як вказано вище), причому в цих групах атоми водню можуть бути частково або повністю заміщені атомами галогену, як вказано вище, наприклад C_1 - C_3 -галогеналкіл, такі як хлорметил, бромметил, 30 дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорфторметил, дихлорфторметил, хлордифторметил, 1-хлоретил, 1-брометил, 1-фторетил, 2-фторетил, 2,2-дифторетил, 2,2,2-трифторетил, 2-хлор-2-фторетил, 2-хлор-2-дифторетил, 2,2-дихлор-2-фторетил, 2,2,2-трихлоретил, пентафторетил і 1,1,1-трифторпроп-2-іл.

Алкеніл: ненасичені, нерозгалужені або розгалужені вуглеводневі залишки, що містять від 2 до 8 атомів вуглецю і подвійний зв'язок у будь-якому положенні, наприклад C_2 - C_6 -алкеніл, такі як етеніл, 1-пропеніл, 2-пропеніл, 1-метилетеніл, 1-бутеніл, 2-бутеніл, 3-бутеніл, 1-метил-1-пропеніл, 2-метил-1-пропеніл, 1-метил-2-пропеніл, 2-метил-2-пропеніл, 1-пентеніл, 2-пентеніл, 3-пентеніл, 4-пентеніл, 1-метил-1-бутеніл, 2-метил-1-бутеніл, 3-метил-1-бутеніл, 1-метил-2-бутеніл, 2-метил-2-бутеніл, 3-метил-2-бутеніл, 1-метил-3-бутеніл, 2-метил-3-бутеніл, 3-метил-3-бутеніл, 1,1-диметил-2-пропеніл, 1,2-диметил-1-пропеніл, 1,2-диметил-2-пропеніл, 1-етил-1-пропеніл, 1-етил-2-пропеніл, 1-гексеніл, 2-гексеніл, 3-гексеніл, 4-гексеніл, 5-гексеніл, 1-метил-1-пентеніл, 2-метил-1-пентеніл, 3-метил-1-пентеніл, 4-метил-1-пентеніл, 1-метил-2-пентеніл, 2-метил-2-пентеніл, 3-метил-2-пентеніл, 4-метил-2-пентеніл, 1-метил-3-пентеніл, 2-метил-3-пентеніл, 3-метил-3-пентеніл, 4-метил-3-пентеніл, 1-метил-4-пентеніл, 2-метил-4-пентеніл, 3-метил-4-пентеніл, 4-метил-4-пентеніл, 1,1-диметил-2-бутеніл, 1,1-диметил-3-бутеніл, 1,2-диметил-1-бутеніл, 1,2-диметил-2-бутеніл, 1,2-диметил-3-бутеніл, 1,3-диметил-1-бутеніл, 1,3-диметил-2-бутеніл, 1,3-диметил-3-бутеніл, 2,2-диметил-3-бутеніл, 2,3-диметил-1-бутеніл, 2,3-диметил-2-бутеніл, 2,3-диметил-3-бутеніл, 3,3-диметил-1-бутеніл, 3,3-диметил-2-бутеніл, 1-етил-1-бутеніл, 1-етил-2-бутеніл, 1-етил-3-бутеніл, 2-етил-1-бутеніл, 2-етил-2-бутеніл, 2-етил-3-бутеніл, 1,1,2-триметил-2-пропеніл, 1-етил-1-метил-2-пропеніл, 1-етил-2-метил-1-пропеніл та 1-етил-2-метил-2-пропеніл.

Циклоалкіл: моноциклічні, насичені вуглеводневі групи, що містять від 3 до 8 членів вуглецевого кільця, такі як циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептил і циклооктил.

55 Арил: незаміщене або заміщене, ароматичне, моно-, бі- або трициклічне кільце, наприклад феніл, нафтил, антраценіл (антрил), фенантраценіл (фенантрил).

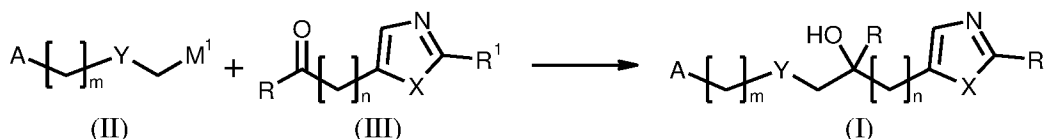
Гетарил: незаміщене або заміщене, ненасичене гетероциклічне 5-7-членне кільце, що містить до 4 атомів азоту або альтернативно 1 атом азоту і до 2 інших гетероатомів, вибраних із групи, що включає N, O і S: наприклад 2-фурил, 3-фурил, 2-тієніл, 3-тієніл, 2-піроліл, 3-піроліл, 1-піроліл, 3-піразоліл, 4-піразоліл, 5-піразоліл, 1-піразоліл, 1H-імідазол-2-іл, 1H-імідазол-4-іл,

1H-імідазол-5-іл, 1H-імідазол-1-іл, 2-оксазоліл, 4-оксазоліл, 5-оксазоліл, 2-тіазоліл, 4-тіазоліл, 5-тіазоліл, 3-ізоксазоліл, 4-ізоксазоліл, 5-ізоксазоліл, 3-ізотіазоліл, 4-ізотіазоліл, 5-ізотіазоліл, 1H-1,2,3-триазол-1-іл, 1H-1,2,3-триазол-4-іл, 1H-1,2,3-триазол-5-іл, 2H-1,2,3-триазол-2-іл, 2H-1,2,3-триазол-4-іл, 1H-1,2,4-триазол-3-іл, 1H-1,2,4-триазол-5-іл, 1H-1,2,4-триазол-1-іл, 4H-1,2,4-триазол-3-іл, 4H-1,2,4-триазол-4-іл, 1H-тетразол-1-іл, 1H-тетразол-5-іл, 2H-тетразол-2-іл, 2H-тетразол-5-іл, 1,2,4-оксадіазол-3-іл, 1,2,4-оксадіазол-5-іл, 1,2,4-тіадіазол-3-іл, 1,2,4-тіадіазол-5-іл, 1,3,4-оксадіазол-2-іл, 1,3,4-тіадіазол-2-іл, 1,2,3-оксадіазол-4-іл, 1,2,3-оксадіазол-5-іл, 1,2,3-тіадіазол-4-іл, 1,2,3-тіадіазол-5-іл, 1,2,5-оксадіазол-3-іл, 1,2,5-тіадіазол-3-іл, 2-піридиніл, 3-піридиніл, 4-піридиніл, 3-піридазиніл, 4-піридазиніл, 2-піримідиніл, 4-піримідиніл, 5-піримідиніл, 2-піразиніл, 1,3,5-триазин-2-іл, 1,2,4-триазин-3-іл, 1,2,4-триазин-5-іл, 1,2,4-триазин-6-іл.

Пояснення способу і проміжних продуктів

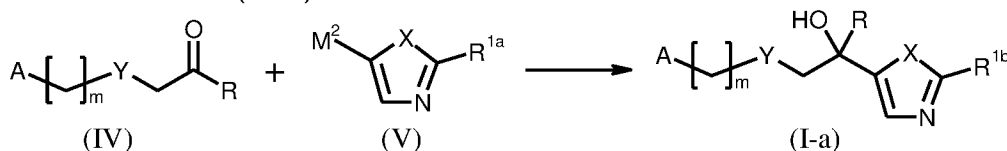
Гетероциклічні похідні алканолів формули (I) можуть бути одержані різними способами (див. EP-A 0 409 418). Далі спочатку наведені схеми можливих способів. Якщо не зазначено інше, вказані залишки мають наведені вище значення.

Схема 1: Спосіб А



M¹ означає метал або галогенід металу, наприклад літій, магній (Mg-Hal, причому Hal означає галоген), титан [Ti(OAlk)₃, причому Alk означає C₁-C₄-алкіл].

Схема 2: Спосіб В (n = 0)

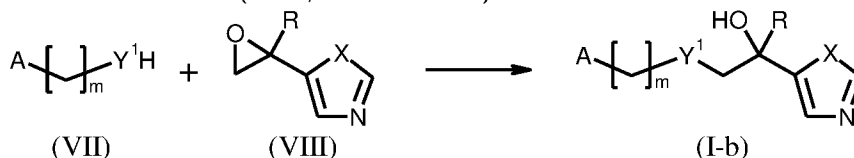


M² означає метал, наприклад літій.

R¹ᵃ означає хлор і Si(алкіл)₃.

R¹ᵇ означає водень, хлор і Si(алкіл)₃.

Схема 3: Спосіб С (n = 0, R¹ означає H)



Y¹ означає O.

Схема 4: Спосіб D (X = S, n = 1, R¹ означає хлор)

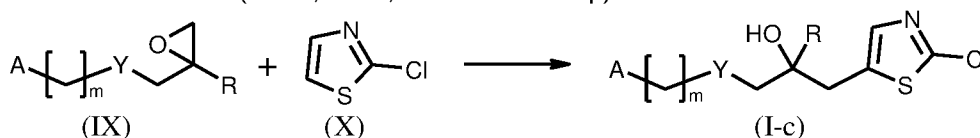
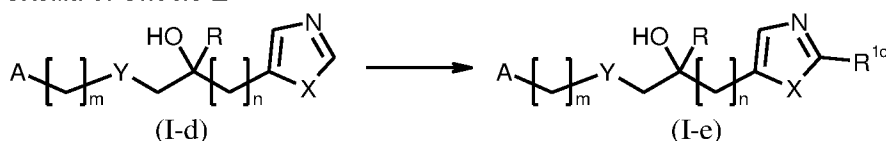
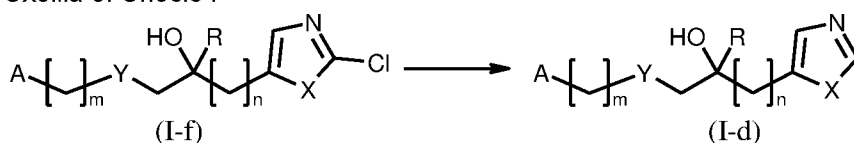


Схема 5: Спосіб Е



R¹ᶜ означає SH, алкілтіо, алкокси, галоген, галогеналкіл, галогеналкілтіо, галогеналкокси, ціано, нітро.

Схема 6: Спосіб F



5 Переважні значення залишків у попередніх і наступних формулах та схемах наведені вище. Ці значення рівною мірою стосуються не лише кінцевих продуктів формули (I), але й усіх проміжних продуктів.

Спосіб A

Необхідні для здійснення відповідного винаходів способу A як вихідні речовини сполуки формули (II) почасти відомі. Вони можуть бути одержані відомим чином (див. публікацію Z. Anorg. Allg. Chem. 2001, 627, 2408-2412).

Кетони формули (III), які також є необхідними як вихідні речовини для здійснення відповідного винаходів способу A, відомі (див. EP-A 0 409 418).

Відповідний винаходів спосіб A у звичайному випадку здійснюють у присутності розріджувача, наприклад діетилового етеру, тетрагідрофурану або дихлорметану, при температурі від -80 °C до +80 °C. Для уловлювання одержаного продукту застосовують донор протонів.

Відповідне винаходів перетворення здійснюють переважно в атмосфері інертного газу, зокрема такого як азот або аргон.

Спосіб B

Необхідні для здійснення відповідного винаходів способу B як вихідні речовини кетони формули (IV) почасти відомі. Вони можуть бути одержані відомими методами (див. EP-A 0 409 418).

Також необхідні для здійснення відповідного винаходів способу B як вихідні речовини металоорганічні гетероцикли формули (V) відомі (див. EP-A 0 409 418 і EP-A 0 395 175).

При одержанні металоорганічних гетероциклів формули (V) залежно від конкретних обставин може бути переважним розміщення в 2-му положенні відповідної захисної групи, наприклад триметилсилілу, для напрямлення M² у 5-е положення. Цю захисну групу можна, але не обов'язково, відщеплювати перед реакцією кетонами формули (IV).

Відповідний винаходів спосіб B у звичайному випадку здійснюють у присутності розріджувача, наприклад тетрагідрофурану або діетилового етеру, при температурі від -120 °C до +80 °C. Для уловлювання одержаного продукту застосовують донор протонів.

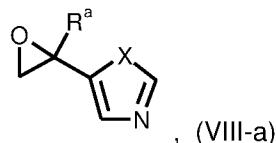
Відповідне винаходів перетворення здійснюють переважно в атмосфері інертного газу, зокрема такого як азот або аргон.

Спосіб C

Необхідні для здійснення відповідного винаходів способу C як вихідні речовини сполуки формули (VII) відомі.

Похідні оксирану формули (VIII), які також є необхідними для здійснення відповідного винаходів способу C, почасти відомі.

Новими є похідні оксирану формули (VIII-a)



в якій

X має наведені вище значення,

R^a означає необов'язково заміщений алкіл (за винятком трет-бутилу, якщо X означає S), алкеніл, циклоалкіл або арил.

R^a означає переважно в кожному випадку необов'язково розгалужений C₃-C₇-алкіл (за винятком трет-бутилу, якщо X означає S), C₁-C₈-галогеналкіл, C₂-C₇-алкеніл, C₂-C₇-галогеналкеніл, означає C₃-C₇-циклоалкіл, необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄-алкілом, C₁-C₄-галоалкілом, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галоалкокси, C₁-C₄-галоалкілтїо або C₁-C₄-алкілтїо, а також означає необов'язково одно-тризаміщений галогеном або C₁-C₄-алкілом феніл.

R^a означає особливо переважно в кожному випадку необов'язково розгалужений C₃-C₅-алкіл за винятком трет-бутилу, C₁-C₆-галогеналкіл, C₃-C₅ алкеніл, C₃-C₅-галогеналкеніл, означає необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄-алкілом, C₁-C₄-галоалкілом, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-

галоалкокси, C₁-C₄-галоалкілтіо або C₁-C₄-алкілтіо C₃-C₆-циклоалкіл.

R^a означає цілком переважно ізопропіл, 1-хлорциклопропіл, 1-фторциклопропіл, 1-метилциклопропіл, 1-метоксициклопропіл, 1-метилтіоциклопропіл, (3E)-4-хлор-2-метилбут-3-ен-2-іл, C₁-C₄-галогеналкіл.

5 Нові похідні оксирану формули (VIII-a) також є предметом винаходу.

Відповідний винаходові спосіб C здійснюють у присутності розріджувача, наприклад N,N-диметилформаміду, і необов'язково в присутності основи, наприклад гідриду натрію або карбонату калію.

Спосіб D

10 Необхідні для здійснення відповідного винаходові способу D як вихідні речовини похідні оксирану формули (IX) почасти відомі (див. EP-A 0 121 171).

2-хлор-1,3-тіазол формули (X) відомий.

Для перетворення сполук формули (IX) можуть бути застосовані металоорганічні сполуки, зокрема алкіллітійові сполуки (наприклад n-бутиллітій) (див. EP-A 0 395 175).

15 Відповідний винаходові спосіб D в звичайному випадку здійснюють у присутності розріджувача, наприклад тетрагідрофурану або діетилового етеру, при температурі від -120 °C до +80 °C. Для уловлювання одержаного продукту застосовують донор протонів.

Відповідне винаходові перетворення здійснюють переважно в атмосфері інертного газу, зокрема такого як азот або аргон.

20 Спосіб E

Одержані в рамках вищеописаних способів сполуки формули (I-d) можуть бути далі піддані перетворенню на цільові сполуки загальної структури (I-e).

Для перетворення сполук формули (I-d) можуть бути застосовані металоорганічні сполуки, зокрема алкіллітійові сполуки (наприклад n-бутиллітій) (див. EP-A 0 906 292).

25 Утворену на проміжній стадії металоорганічну сполуку в звичайному випадку за допомогою електрофілу (наприклад сірки, алкілгалогеніду, інтергалогенної сполуки) перетворюють на цільову сполуку (I-e).

30 Відповідний винаходові спосіб E в звичайному випадку здійснюють у присутності розріджувача, наприклад тетрагідрофурану або діетилового етеру, при температурі від -120 °C до +80 °C. Для уловлювання одержаного продукту застосовують донор протонів.

Відповідне винаходові перетворення здійснюють переважно в атмосфері інертного газу, зокрема такого як азот або аргон.

Спосіб F

35 Одержані в рамках вищеописаних способів сполуки формули (I-f) можуть бути далі піддані перетворенню на цільові сполуки загальної структури (I-d).

Для перетворення сполук формули (I-f) можуть бути застосовані метали, переважно цинк (див. EP-A 0 395 175).

40 Відповідний винаходові спосіб F у звичайному випадку здійснюють у присутності розріджувача, наприклад тетрагідрофурану або органічних кислот, наприклад оцтової кислоти, при температурі від -120 °C до +150 °C.

Відповідні винаходові гетероциклічні похідні алканолів загальної формули (I) можуть бути переведені в кислотно-адитивні солі чи комплекси солей металів.

45 Для одержання фізіологічно сумісних кислотно-адитивних солей сполук загальної формули (I) переважно застосовують наведені далі кислоти: галогеноводневі кислоти, такі як, наприклад, хлороводнева кислота і бромід водню, насамперед хлороводневу кислоту, а також фосфорну кислоту, азотну кислоту, сірчану кислоту, моно- і біфункціональні карбонові та гідроксикислоти, такі як, наприклад, оцтова кислота, малеїнова кислота, бурштинова кислота, фумарова кислота, винна кислота, лимонна кислота, саліцилова кислота, сорбінова кислота, молочна кислота, а також сульфонові кислоти, такі як, наприклад, p-толуолсульфорова кислота і 1,5-нафталіндисульфорова кислота.

50 Кислотно-адитивні солі сполук загальної формули (I) можуть бути одержані простими традиційними методами, наприклад шляхом розчинення сполуки загальної формули (I) у придатному до застосування інертному розчиннику і додавання кислоти, наприклад хлороводневої кислоти, і відокремлені відомим методом, наприклад фільтруванням, та необов'язково очищені шляхом промивання інертним органічним розчинником.

55 Для одержання комплексів солей металів сполук загальної формули (I) застосовують переважно солі металів II - IV головної групи та I та II, а також IV - VIII підгрупи періодичної системи елементів, прикладами яких є мідь, цинк, марганець, магній, олово, залізо і нікель.

60 Придатними до застосування є такі аніони солей, які походять переважно від наведених далі кислот: галогеноводневі кислоти, такі як, наприклад, хлороводнева кислота і бромід водню, а також фосфорна кислота, азотна кислота і сірчана кислота.

Комплекси солей металів сполук загальної формули (I) можуть бути одержані простими традиційними методами, наприклад шляхом розчинення солі металу в спирті, наприклад

етанолі, і додавання до сполуки загальної формули (I). Комплекси солей металів можна відокремлювати відомими методами, наприклад шляхом фільтрування, і в разі необхідності очищати шляхом перекристалізації.

Винахід стосується також засобу захисту рослин для боротьби зі шкідливими мікроорганізмами, зокрема шкідливими грибами, який містить відповідні винаходу активні речовини. Переважно йдеться про фунгіцидні засоби, які містять придатні до застосування в сільському господарстві допоміжні засоби, розчинники, носії, поверхнево-активні речовини або розріджувачі.

Окрім цього, винахід стосується способу боротьби зі шкідливими мікроорганізмами, який відрізняється тим, що відповідні винаходів активні речовини наносять на фітопатогенні шкідливі гриби та/або на їх життєвий простір.

Згідно з винаходом носієм є природна або синтетична, органічна або неорганічна речовина, з якою змішують або зв'язують активні речовини для поліпшення їх придатності до застосування, зокрема для нанесення на рослини або частини рослин чи на посівний матеріал. Носій, який може бути твердим чи рідким, в загальному випадку є інертним і має бути придатним до застосування в сільському господарстві.

Як тверді або рідкі носії застосовують наприклад солі амонію і природні подрібнені породи, такі як каоліни, глиноземи, тальк, крейда, кварц, атапульгіт, монтморилоніт або діатомова земля, і синтетичні подрібнені породи, такі як високодисперсна кремнієва кислота, оксид алюмінію і природні або синтетичні силікати, смоли, воски, тверді добрива, воду, спирти, особливо бутанол, органічні розчинники, мінеральні та рослинні жири, а також їх похідні. Можна застосовувати також суміші таких носіїв. Застосовуваними твердими носіями для гранулят є наприклад подрібнені та фракціоновані природні породи, такі як кальцит, мармур, пемза, сепіоліт, доломіт, та синтетичні грануляти з неорганічного та органічного борошна, а також грануляти з органічного матеріалу, такого як тирса, шкаралупа кокосових горіхів, кукурудзяні качани і стебла тютюнових рослин.

Як зріджені газоподібні розріджувачі або носії застосовують такі рідини, які є газоподібними при нормальній температурі та під нормальним тиском, наприклад аерозольні паливні гази, такі як галогеновуглеводні, а також бутан, пропан, азот і діоксид вуглецю.

У композиціях можуть бути застосовані адгезійні засоби, такі як карбоксиметилцелюлоза, природні та синтетичні порошкоподібні, зернисті або латексоподібні полімери, такі як гуміарабік, полівініловий спирт, полівінілацетат, а також природні фосфоліпіди, такі як кефаліни та лецитини, і синтетичні фосфоліпіди. Іншими добавками можуть бути мінеральні та рослинні жири.

У разі використання води як розріджувача можуть бути застосовані також допоміжні органічні розчинники. Застосовують в основному такі рідкі розчинники, як ароматичні речовини, наприклад ксилол, толуол або алкілнафталіни, хлоровані ароматичні речовини або хлоровані аліфатичні вуглеводні, наприклад хлорбензоли, хлоретилени або дихлорметан, аліфатичні вуглеводні, такі як циклогексан або парафіни, наприклад нафтові фракції, мінеральні та рослинні жири, спирти, такі як бутанол або гліколь, а також їх етери та естери, кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон або циклогексанон, сильнополярні розчинники, такі як диметилформамід та диметилсульфоксид, а також воду.

Відповідні винаходу засоби можуть містити додатково інші компоненти, такі як, наприклад, поверхнево-активні речовини. Застосовують такі поверхнево-активні речовини, як емульгатори та/або спінювачі, диспергатори або змочувальні речовини, які мають іонні або неіонні властивості, чи суміші цих поверхнево-активних речовин. Прикладами таких речовин є солі поліакрилової кислоти, солі лігносульфонової кислоти, солі фенолсульфонової кислоти або нафталінсульфонової кислоти, продукти поліконденсації етиленоксиду з жирними спиртами або жирними кислотами, або з жирними амінами, заміщені феноли (переважно алкілфеноли або арилфеноли), солі естерів сульфобурштинової кислоти, похідні таурину (переважно алкілтаурати), естери фосфорної кислоти та поліетоксильованих спиртів або фенолів, естери жирних кислот і поліолів, а також похідні сполук, які містять сульфати, сульфонати і фосфати, наприклад алкіларилполігліколевий етер, алкілсульфонати, алкілсульфати, арилсульфонати, білкові гідролізати, лігнін-сульфітні луги та метилцелюлоза. Присутність поверхнево-активної речовини є необхідною в тому випадку, якщо одна із активних речовин та/або один із інертних носіїв не розчиняються у воді, і якщо засоби застосовують у воді. Вміст поверхнево-активних речовин становить від 5 до 40 масових відсотків відносно загальної кількості відповідного винаходів засобу.

Можуть бути застосовані барвники, такі як неорганічні пігменти, наприклад оксид заліза, оксид титану, фероціановий синій, та органічні барвники, такі як алізаринові барвники,

азобарвники та металфталоціанінові барвники, а також живильні мікроелементи, такі як солі заліза, марганцю, бору, міді, кобальту, молібдену та цинку.

У разі необхідності можуть бути застосовані також інші додаткові компоненти, наприклад захисні колоїди, зв'язувальні засоби, адгезиви, згущувачі, тиксотропні речовини, посилювачі пенетрації, стабілізатори, секвестранти, комплексоутворювачі. Взагалі активні речовини можна комбінувати з будь-якими твердими або рідкими добавками, які зазвичай застосовують для виготовлення композицій.

У загальному випадку відповідні винаходів засоби і композиції містять від 0,05 до 99 мас. %, від 0,01 до 98 мас. %, переважно від 0,1 до 95 мас. %, особливо переважно від 0,5 до 90 мас. % активної речовини, цілком переважно від 10 до 70 масових відсотків.

Відповідні винаходи активні речовини та засоби можуть бути застосовані самі по собі або, залежно від їх фізичних та/або хімічних властивостей, у формі композицій або виготовлених із них форм застосування, таких як аерозолі, капсульовані суспензії, концентрати для утворення аерозолів гарячим та холодним способом, капсульовані грануляти, дрібнозернисті грануляти, плинні концентрати для обробки посівного матеріалу, готові до застосування розчини, розпилювані порошки, придатні до емульгування концентрати, емульсії "масло-в-воді" та "вода-в-маслі", макрогрануляти, мікрогрануляти, порошки, придатні до диспергування в жирі, змішувані з жиром плинні концентрати, змішувані з жиром рідини, піни, пасту, посівний матеріал, вкритий пестицидною оболонкою, концентрати суспензій, концентрати суспензій, розчинні концентрати, суспензії, порошки для обприскування, розчинні порошки, дисти і грануляти, водорозчинні грануляти або таблетки, водорозчинні порошки для обробки посівного матеріалу, змочувані порошки, просочені активною речовиною природні та синтетичні матеріали, мікрокапсули в полімерних матеріалах і масах для обволікання посівного матеріалу, а також композиції для утворення ультрамалооб'ємних (ULV) аерозолів холодним і гарячим способами.

Зазначені композиції можуть бути виготовлені відомим методом, наприклад шляхом змішування активних речовин принаймні з одним звичайним розчинником чи розріджувачем, емульгатором, диспергатором та/або зв'язувальним або фіксувальним засобом, змочувальним засобом, водним репелентом, в разі необхідності сикативами та УФ-стабілізаторами, а також не обов'язково барвниками і пігментами, антиспінювачами, консервантами, вторинними згущувачами, адгезивами, гіберелінами та іншими допоміжними засобами для обробки.

Відповідні винаходів засоби охоплюють не лише вже готові до застосування композиції, які можуть бути нанесені на рослини або посівний матеріал за допомогою відповідного устаткування, але й промислові концентрати, які перед застосуванням необхідно розбавляти водою.

Відповідні винаходів активні речовини можуть бути застосовані самі по собі чи у складі (комерційно доступних) композицій, а також у виготовлених із цих композицій формах застосування в суміші з іншими (відомими) активними речовинами, такими як інсектициди, атрактанти, стериланти, бактерициди, акарициди, нематоциди, фунгіциди, регулятори росту, гербіциди, добрива, антидоти та хімічні сигнальні речовини (англ. Semiochemicals).

Відповідну винаходів обробку рослин і частин рослин активними речовинами чи засобами здійснюють безпосередньо або шляхом дії на їх оточення, життєвий простір або складське приміщення звичайними методами, наприклад шляхом занурення, обприскування чи розприскування, оббризування чи розбризування, зрошення, випаровування, розпилення, аерозольної обробки, посипання чи розкидання, спінування, намащування, обливання (поливання), крапельного зрошення, а обробку вихідного матеріалу для вегетативного розмноження, зокрема насіння, додатково шляхом сухого чи мокрого протруєння, протруєння суспензіями, інкрустації, покриття одно- чи багатошаровою оболонкою тощо. Можна також наносити активні речовини шляхом утворення ультрамалооб'ємних аерозолів або вводити в ґрунт композиції активних речовин або самі активні речовини шляхом ін'єкцій.

Винахід стосується також способу обробки посівного матеріалу.

Винахід стосується також посівного матеріалу, який був оброблений одним із описаних у попередньому абзаці методів. Відповідні винаходів посівні матеріали використовують у способі захисту посівного матеріалу від небажаних мікроорганізмів. У цьому способі використовують посівний матеріал, оброблений принаймні однією відповідною винаходів активною речовиною.

Відповідні винаходів активні речовини чи засоби придатні також для обробки посівного матеріалу. Великий обсяг шкоди, заподіяної культурним рослинам шкідливими організмами, зумовлений ураженням посівного матеріалу під час зберігання або після сівби, а також під час і після проростання рослин. Це особливо критична стадія розвитку, оскільки корені та паростки рослин у процесі росту є особливо чутливими, і навіть дрібне пошкодження може призвести до

загибелі рослини. Тому дуже важливо забезпечити захист посівного матеріалу і проростаючих рослин шляхом застосування відповідних засобів.

Способи боротьби з фітопатогенними грибами шляхом обробки посівного матеріалу рослин здавна відомі і постійно вдосконалюються. Попри це при обробці посівного матеріалу виникають проблеми, які не завжди вдається успішно вирішити. Тому бажано розробити такі способи захисту посівного матеріалу і проростаючих рослин, які не потребували б додаткового нанесення засобів для захисту рослин після сівби чи появи сходів рослин або принаймні дозволяли б значно зменшити обсяг застосування таких засобів. Також бажано оптимізувати кількість застосовуваної активної речовини настільки, щоб забезпечити якнайкращий захист посівного матеріалу і проростаючих рослин від ураження фітопатогенними грибами без пошкодження самих рослин застосовуваною активною речовиною. Зокрема, способи обробки посівного матеріалу мають бути розраховані на використання власних фунгіцидних властивостей трансгенних рослин, щоб забезпечити оптимальний захист посівного матеріалу і проростаючих рослин при мінімальних витратах засобів захисту рослин.

Тому винахід стосується також способу захисту посівного матеріалу і проростаючих рослин від ушкодження фітопатогенними грибами, в якому посівний матеріал обробляють відповідним винаходом засобом. Винахід стосується також застосування відповідних винаходів засобів для обробки посівного матеріалу для захисту посівного матеріалу і проростаючих рослин проти фітопатогенних грибів. Крім цього, винахід стосується посівного матеріалу, який для захисту від фітопатогенних грибів був оброблений відповідним винаходом засобом.

Для боротьби з фітопатогенними грибами, які уражують рослини після проростання, застосовують насамперед обробку ґрунту і надземних частин рослин засобами для захисту рослин. У зв'язку з побоюваннями відносно можливого впливу засобів захисту рослин на довкілля і здоров'я людей і тварин намагаються зменшити кількість застосовуваних активних речовин.

Однією з переваг винаходу є те, що внаслідок особливих системних властивостей відповідних винаходів активних речовин та засобів обробка посівного матеріалу цими активними речовинами та засобами забезпечує захист від ураження фітопатогенними грибами не лише самого посівного матеріалу, але й проростаючих із нього рослин. Завдяки цьому немає потреби в безпосередній обробці культури на момент сівби або невдовзі по її завершенні.

Також слід вважати перевагою те, що відповідні винаходи активні речовини та засоби можуть бути застосовані зокрема для обробки трансгенного посівного матеріалу. причому рослина, що проростає з цього посівного матеріалу, виявляється здатною до синтезу білка, який протидіє шкідникам. Обробка такого посівного матеріалу відповідними винаходами активними речовинами та засобами дозволяє забезпечити захист від певних шкідників завдяки експресії, наприклад, інсектицидного білка. При цьому несподівано було виявлено додатковий синергічний ефект, який посилює ефективність захисту від ушкодження шкідниками.

Відповідні винаходи засоби придатні для захисту посівного матеріалу будь-яких сортів рослин у сільському господарстві, в теплицях, на лісових угіддях або в садівництві та виноградарстві. Зокрема, при цьому йдеться про посівний матеріал зернових культур (таких як пшениця, ячмінь, жито, тритикале, просо та овес), кукурудзи, бавовнику, сої, рису, картоплі, соняшника, бобів, кави, буряку (наприклад цукрового та кормового буряку), арахісу, рапсу, маку, маслини, кокосу, какао, цукрової тростини, тютюну, овочів (таких як томати, огірки, цибуля і салат), трав і декоративних рослин (див. також далі). Особливе значення має обробка посівного матеріалу зернових культур (таких як пшениця, ячмінь, жито, тритикале та овес), кукурудзи та рису.

Як описано далі, обробка трансгенного посівного матеріалу відповідними винаходами активними речовинами чи засобами має особливе значення. Це стосується посівного матеріалу рослин, які містять принаймні один гетерологічний ген, що уможливорює експресію поліпептиду чи білка, які мають інсектицидні властивості. Гетерологічний ген у трансгенному посівному матеріалі може походити, наприклад, із мікроорганізмів видів *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* або *Gliocladium*. Переважно цей гетерологічний ген походить із *Bacillus* sp., причому генопродукт є ефективним проти кукурудзяного метелика (European corn borer) та/або західного кукурудзяного жука (Western Corn Rootworm). особливо переважно гетерологічний ген походить із *Bacillus thuringiensis*.

У рамках винаходу на посівний матеріал наносять або відповідні винаходи засоби, або придатні до застосування композиції, що містять ці засоби. Переважно посівний матеріал обробляють у настільки стабільному стані, що його ушкодження в процесі обробки є неможливим. У загальному випадку обробку посівного матеріалу можна здійснювати в будь-який момент часу між збиранням врожаю та сівбою. Зазвичай застосовують посівний матеріал,

який відокремлений від рослини і очищений від качанів, шкаралупи, стебел, оболонки, волокон або м'якоті плодів. Наприклад, можна застосовувати посівний матеріал, який був зібраний, очищений і висушений до вологості менше ніж 15 мас. %. Альтернативно може бути застосований також посівний матеріал, який після висушування був, наприклад, оброблений водою і знову висушений.

Узагалі при обробці посівного матеріалу слід стежити за тим, щоб кількість нанесеного на посівний матеріал відповідного винаходу засобу та/або інших додаткових речовин була підібрана таким чином, щоб уникнути негативного впливу на проростання посівного матеріалу та пошкодження проростаючої з нього рослини. Це слід враховувати насамперед у разі застосування активних речовин, певні норми витрати яких можуть спричиняти фітотоксичні ефекти.

Відповідні винаходи засоби можна наносити безпосередньо, тобто без додавання інших компонентів і розбавлення. Як правило, переважним є варіант нанесення засобів на посівний матеріал у формі відповідної композиції. Відповідні композиції та способи обробки посівного матеріалу відомі фахівцям і описані, наприклад, у таких публікаціях: US 4,272,417 A, US 4,245,432 A, US 4,808,430 A, US 5,876,739 A, US 2003/0176428 A1, WO 2002/080675 A1, WO 2002/028186 A2.

Придатні до застосування згідно з винаходом активні речовини можуть бути переведені в стандартні композиції для протруювання, такі як розчини, емульсії, суспензії, порошки, піни, гідросуміші або інші обволікаючі маси для посівного матеріалу, а також композиції для утворення ультрамалооб'ємних (ULV) аерозолів.

Ці композиції виготовляють відомими методами шляхом змішування активних речовин зі звичайними додатковими речовинами, наприклад традиційними засобами для розбавлення, а також розчинниками або розріджувачами, барвниками, змочувальними засобами, диспергаторами, емульгаторами, антиспіювачами, консервантами, вторинними згущувачами, клеями, гіберелінами, а також водою.

Барвниками, які можуть входити до складу придатних до застосування згідно з винаходом композицій для протруювання, є всі стандартні застосовувані для подібних цілей барвники. Для цього можуть бути застосовані як мало розчинні у воді пігменти, так і водорозчинні барвники. Як приклади слід вказати відомі барвники Родамін Б (Rhodamin B), червоні пігменти C.I. Pigment Red 112 та C.I. Solvent Red 1.

Змочувальними засобами, які можуть входити до складу придатних до застосування згідно з винаходом композицій для протруювання, є всі стандартні застосовувані в композиціях агрохімічних активних речовин засоби, що поліпшують змочування. Переважно застосовуваними змочувальними засобами є алкілнафталінсульфонати, такі як діізопропіл- або діізобутил-нафталінсульфонати.

Диспергаторами та/або емульгаторами, які можуть входити до складу придатних до застосування згідно з винаходом композицій для протруювання, є всі стандартні застосовувані в композиціях агрохімічних активних речовин неіонні, аніонні та катіонні диспергуючі засоби. Переважно придатними до застосування є неіонні чи аніонні диспергатори або суміші неіонних чи аніонних диспергаторів. Придатними до застосування неіонними диспергаторами є насамперед блок-співполімери етиленоксиду і пропіленоксиду, алкілфенол-полігліколевий етер, а також тристирилфенол-полігліколевий етер та їх фосфатовані або сульфатовані похідні. Придатними до застосування аніонними диспергаторами є насамперед лігнінсульфонати, солі поліакрилової кислоти та продукти поліконденсації формальдегіду з арилсульфонатом.

Антиспіювачами, які можуть входити до складу придатних до застосування згідно з винаходом композицій для протруювання, є всі стандартні застосовувані в композиціях агрохімічних активних речовин засоби, що пригнічують спінування. Переважно придатними до застосування є силіконові піногасники та стеарат магнію.

Консервантами, які можуть входити до складу придатних до застосування згідно з винаходом композицій для протруювання, є всі стандартні засоби, застосовувані в агрохімічних засобах для подібних цілей. Як приклади слід вказати дихлорофен та геміформаль бензилового спирту.

Вторинними згущувачами, які можуть входити до складу придатних до застосування згідно з винаходом композицій для протруювання, є всі стандартні засоби, застосовувані в агрохімічних засобах для подібних цілей. Переважно застосовують похідні целюлози, похідні акрилової кислоти, ксантан, модифіковані глини та високодисперсну кремнієву кислоту.

Клеями, які можуть входити до складу придатних до застосування згідно з винаходом композицій для протруєння, є всі стандартні зв'язувальні засоби, придатні до застосування в засобах для протруєння. Переважно застосовують полівінілпіролідон, полівінілацетат,

полівініловий спирт і тилозу.

Гіберелінами, які можуть входити до складу придатних до застосування згідно з винаходом композицій для протруєння, є переважно гібереліни А1, А3 (гіберелінова кислота), А4 та А7; особливо переважно застосовують гіберелінову кислоту. Гібереліни є відомими речовинами (див. R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schddlingsbekdmpfungsmittel" ("Хімія пестицидів"), том 2, видавництво Springer Verlag, 1970, стор. 401-412).

Придатними до застосування згідно з винаходом композиціями засобів для протруювання можна або безпосередньо, або після попереднього розведення водою обробляти посівний матеріал найрізноманітніших видів, також посівний матеріал трансгенних рослин. При цьому в процесі взаємодії з речовинами, утворюваними в результаті експресії, можуть виникати також додаткові синергічні ефекти.

Для обробки посівного матеріалу придатними до застосування згідно з винаходом композиціями для протруювання або виготовленими з них шляхом додавання води препаративними формами придатні всі змішувальні пристрої, які взагалі застосовують для протруювання. Зокрема, для протруювання посівний матеріал закладають у змішувач, додають бажану кількість композицій засобів для протруювання, або без розбавлення, або після попереднього розбавлення водою, і перемішують для рівномірного розподілу композиції на посівному матеріалі. В разі необхідності посівний матеріал потім висушують.

Відповідні винаховоді активні речовини та засоби проявляють сильну мікробіцидну дію і можуть бути застосовані для боротьби зі шкідливими мікроорганізмами, такими як гриби і бактерії, в галузі захисту рослин і матеріалів.

Фунгіцидні засоби можуть бути застосовані в галузі захисту рослин для боротьби з грибами класів плазмодіофоровіцети (Plasmodiophoromycetes), оомицети (Oomycetes), хитридіоміцети (Chytridiomycetes), зігоміцети (Zygomycetes), аскоміцети (Ascomycetes), базидіоміцети (Basidiomycetes) і дейтеромицети (Deuteromycetes).

Бактерицидні засоби можуть бути застосовані в галузі захисту рослин для боротьби з бактеріями сімейств псевдомонади (Pseudomonadaceae), різобії (Rhizobiaceae), ентеробактерії (Enterobacteriaceae), коринобактерії (Corynebacteriaceae) і стрептомицети (Streptomycetaceae).

Відповідні винаховоду фунгіцидні засоби можуть бути застосовані для лікування або захисту від ураження фітопатогенними грибами. Тому винахід стосується також способу лікування і захисту для боротьби з фітопатогенними грибами шляхом застосування відповідних винаховоді активних речовин або засобів, які наносять на посівний матеріал, рослини або частини рослин, плоди або ґрунт, на якому ростуть рослини.

Відповідні винаховоді засоби для боротьби з фітопатогенними грибами містять ефективну, але не фітотоксичну кількість відповідних винаховоді активних речовин. "Ефективна, але не фітотоксична кількість" відповідає кількості відповідного винаховоді засобу, яка є достатньою для забезпечення достатнього контролю або повного знищення грибкових захворювань рослин і водночас не спричиняє жодних суттєвих симптомів фітотоксичності. Ця кількість у загальному випадку може варіювати в широких межах. Вона залежить від багатьох чинників, наприклад від конкретного гриба, який підлягає знищенню, рослини, кліматичних умов і компонентів відповідних винаховоді засобів.

Добра переносимість рослинами активних речовин у концентраціях, необхідних для боротьби із захворюваннями рослин, дозволяє застосовувати їх для обробки надземних частин рослин, садового і посівного матеріалу та ґрунту.

Згідно з винаходом можна обробляти всі рослини і частини рослин. При цьому поняття "рослини" охоплює всі рослини і популяції рослин, такі як корисні та бур'янові дикоростучі рослини або культурні рослини (включаючи культурні рослини, які ростуть у природних умовах). Культурними рослинами можуть бути рослини, які можуть бути одержані традиційними методами вирощування і оптимізації або методами біотехнологій та генної інженерії чи комбінаціями цих методів, включаючи трансгенні рослини, а також сорти рослин, які підпадають або не підпадають під сферу правового захисту сортових свідоцтв. Поняття "частини рослин" охоплює всі надземні та підземні частини і органи рослин, такі як пагін, лист, квітка і корінь, прикладами яких є листя, хвоя, стебла, стволи, квіти, плодові тіла, плоди і насіння, а також коріння, бульби та ризоми. До частин рослин належить також зібраний врожай, а також вегетативний і генеративний матеріал для розмноження, наприклад черешки, бульби, ризоми, відсадки та насіння.

Відповідні винаховоді активні речовини, які добре переносяться рослинами, відрізняються низькою токсичністю для теплокровних тварин і не шкідливі для довкілля, придатні для захисту рослин і органів рослин, підвищення врожайності, поліпшення якості рослинницької продукції. Вони можуть бути застосовані переважно як засоби для захисту рослин. Вони проявляють

ефективність проти нормально чутливих і резистентних видів, а також проти всіх або окремих стадій розвитку.

Рослинами, які можна обробляти згідно з винаходом, є бавовник, льон, виноград, фрукти, овочі, такі як *Rosaceae* sp. (наприклад зерняткові плоди, такі як яблука і груші, а також кісточкові плоди, такі як абрикоси, вишні, мигдаль і персики, та садово-ягідні культури, такі як суниця), *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (наприклад бананові рослини і плантації), *Rubiaceae* sp. (наприклад кава), *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (наприклад лимони, апельсини і грейпфрути); *Solanaceae* sp. (наприклад томати), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (наприклад салат), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp. (наприклад огірок), *Alliaceae* sp. (наприклад часник, цибуля), *Papilionaceae* sp. (наприклад горох); головні корисні рослини, такі як *Gramineae* sp. (наприклад кукурудза, трави, зернові, такі як пшениця, жито, рис, ячмінь, овес, просо і тритикале), *Poaceae* sp. (наприклад цукрова тростина), *Asteraceae* sp. (наприклад соняшник), *Brassicaceae* sp. (наприклад білокачанна та червонокачанна капуста, броколі, цвітна капуста, брюсельська капуста, китайська капуста (пак-чой), кольрабі, редис, а також рапс, гірчиця, хрін та крес-салат), *Fabaceae* sp. (наприклад боби, арахіс), *Papilionaceae* sp. (наприклад соя), *Solanaceae* sp. (наприклад картопля), *Chenopodiaceae* sp. (наприклад цукровий та кормовий буряк, мангольд, столовий буряк); корисні та декоративні рослини в садах і лісах; а також генетично модифіковані види цих рослин.

Як було зазначено вище, згідно з винаходом можна обробляти всі рослини та їх частини. У переважній формі виконання винаходу обробляють дикорослі або одержані традиційними біологічними методами вирощування, такими як схрещування або синтез протопластів, види і сорти рослин, а також їх частини. В іншій переважній формі виконання винаходу обробляють трансгенні рослини і сорти рослин, одержані методами генної інженерії, залежно від конкретних обставин в поєднанні з традиційними методами (генетично модифіковані організми, *Genetically Modified Organisms*), та їх частини. Пояснення поняття "частини" або "частини рослин" було наведено вище. Особливо переважно згідно з винаходом обробляють рослини комерційно доступних або традиційно вживаних сортів. Поняття "сорта рослин" застосовують для рослин із новими властивостями (англ. *Traits*), які були одержані традиційними способами вирощування, шляхом мутагенезу або методами рекомбінації ДНК. Це можуть бути сорти, породи, біо- та генотипи.

Відповідний винаходові спосіб обробки може бути застосований до генетично модифікованих організмів (ГМО), наприклад рослин або насіння. Генетично модифікованими (або трансгенними) є рослини, в яких гетерологічний ген стабільно інтегрований у геном. Поняття "гетерологічний ген" означає по суті ген, створений або асембльований поза рослиною, який при введенні в геном клітинного ядра, хлоропласту або іпохондрії надає трансформованій рослині нових або поліпшених агрономічних або інших властивостей за рахунок витиснення відповідного білка або поліпептиду, або пригнічення чи відключення іншого гену чи генів, який чи які існують в рослині (наприклад із застосуванням антисмислової (англ. *Antisense*) або косупресивної технології, або технології на основі РНК-інтерференції (*RNAi*, *RNA Interference*)). Гетерологічний ген, який існує в геномі, називають також трансгеном. Трансген, властивості якого визначені його специфічним положенням у геномі рослини, називають трансформаційною або трансгенною подією (англ. *Event*).

Залежно від видів або сортів рослин, їх місцезнаходження та умов росту (ґрунту, клімату, вегетаційного періоду, живлення) відповідна винаходу обробка може спричиняти також суперадитивні ("синергічні") ефекти. Можливі, наприклад, такі ефекти, які виходять за межі очікуваних: зменшення норми витрати та/або розширення спектру дії, та/або підвищення ефективності активних речовин і композицій, які можуть бути застосовані згідно з винаходом, поліпшення росту рослин, збільшення стійкості до високих або низьких температур, сухості, вологості або засоленості ґрунту, підвищення інтенсивності цвітіння, полегшення процесу збирання врожаю, прискорення визрівання, зростання врожайності, збільшення розміру плодів та висоти рослин, насиченіший зелений колір листя, прискорення початку цвітіння, підвищення якості та/або поживності зібраного врожаю, збільшення концентрації цукру в плодах, покращання придатності до зберігання та/або обробки рослинницької продукції.

У разі дотримання певних норм витрати відповідні винаходові активні речовини можуть справляти на рослини зміцнювальну дію. Тому вони придатні до застосування як засоби мобілізації захисних сил рослин для підвищення їх стійкості до ураження шкідливими фітопатогенними грибами та/або мікроорганізмами, та/або вірусами. Залежно від конкретних обставин це може бути однією з причин підвищення ефективності відповідних винаходові

комбінацій, наприклад проти грибів. Речовинами, які зміцнюють рослини (підвищують їх стійкість), у цьому сенсі є також речовини або комбінації речовин, які здатні зміцнювати захисну систему рослин таким чином, що після інокуляції оброблених ними рослин шкідливими фітопатогенними грибами стійкість рослин до цих шкідливих фітопатогенних грибів значно зростає. Тому відповідні винаходи речовини можуть бути застосовані для захисту рослин від ураження вищезазначеними патогенами протягом певного періоду часу після обробки. Період часу, протягом якого забезпечується захисна дія, в загальному випадку становить від 1 до 10 діб, переважно від 1 до 7 діб після обробки рослин активними речовинами.

До рослин і сортів рослин, переважно оброблюваних згідно з винаходом, віднесені усі рослини, що мають комплекс цінних спадкових чинників, які надають цим рослинам особливо корисних ознак (причому однаково, було це досягнуто шляхом селекції та/або біотехнологій).

Рослини і сорти рослин, також переважно оброблювані згідно з винаходом, є стійкими до одного чи кількох біотичних стресорів, тобто ці рослини відрізняються підвищеним рівнем захисту від шкідливих тварин і мікробів, таких як нематоди, комахи, кліщі, фітопатогенні гриби, бактерії, віруси та/або віроїди.

Рослинами і сортами рослин, які також можуть бути оброблені згідно з винаходом, є рослини, стійкі проти одного чи кількох абіотичних стресорів. До абіотичних стресорів належать, наприклад, посуха, холод і спека, осмотичний стрес, застій вологи, підвищена солоність ґрунту, посилений вплив мінеральних речовин, озонне навантаження, надмірна інтенсивність освітлення, обмежена кількість азотних чи фосфорних живильних речовин або відсутність тіні.

Рослинами і сортами рослин, які також можуть бути оброблені згідно з винаходом, є рослини, що відрізняються підвищеною врожайністю. Підвищена врожайність таких рослин може бути зумовлена, наприклад, поліпшеними параметрами фізіології, росту і розвитку рослин, такими як ефективність використання і утримання води, покращання засвоєння азоту та асиміляції вуглецю, інтенсифікація фотосинтезу, підвищена активність проростання і прискорене визрівання. Крім цього, покращання будови рослин (у стресових та нестресових умовах) може впливати на врожайність, у тому числі на прискорення початку фази цвітіння, контроль цвітіння для одержання гібридного посівного матеріалу, швидкорослість ростків, висоту рослин, кількість і довжину міжвузль, ріст коренів, розмір насінин, плодів, стручків, кількість стручків або колосків, кількість насінин у стручку або в колосі, масу насінин, збільшення наповненості насінин, зменшення випадіння насінин та розтріскування стручків, а також підвищену стійкість рослин до полягання. Іншими ознаками високої врожайності є склад насінин, а саме вміст вуглеводів, білків, жирів та склад жирів, поживність, зменшення вмісту сполук, які не мають живильної цінності, поліпшена придатність до обробки і зберігання.

Рослинами, які можуть бути оброблені згідно з винаходом, є гібридні рослини, які вже проявляють ознаки гетерозису чи гетерозисного ефекту, наслідком чого в загальному випадку є підвищення врожайності, швидкорослості, поліпшення здоров'я рослин і збільшення їх стійкості до біотичних та абіотичних стресорів. Такі рослини зазвичай одержують, схрещуючи виведену шляхом інцухту андростерильну батьківську лінію (жіночий партнер при схрещуванні) з іншою виведеною шляхом інцухту андрофертильною батьківською лінією (чоловічий партнер при схрещуванні). В типовому випадку збирають врожай гібридного посівного матеріалу андростерильних рослин і продають репродуктору. Андростерильні рослини (наприклад, кукурудзи) іноді можуть бути одержані шляхом видалення волотей (тобто механічного видалення чоловічих статевих органів чи квіток), проте зазвичай андростерильність ґрунтується на генетичних детермінантах у геномі рослини. В цьому випадку, насамперед якщо бажаний продукт, який хочуть отримати як врожай від гібридних рослин, є насінням, як правило, доцільно забезпечувати повне відновлення андрофертильності у гібридних рослинах, які містять відповідальні за андростерильність генетичні детермінанти. Для цього необхідно забезпечити, щоб чоловічі партнери при схрещуванні мали відповідні гени, відповідальні за відновлення фертильності, здатні відновлювати андрофертильність у гібридних рослинах, які містять генетичні детермінанти, відповідальні за андростерильність. Відповідальні за андростерильність генетичні детермінанти можуть бути локалізовані в цитоплазмі. Приклади цитоплазматичної андростерильності (ЦАС) описані, наприклад, для видів Brassica. Проте, відповідальні за андростерильність генетичні детермінанти можуть бути локалізовані також у геномі клітинного ядра. Андростерильні рослини можуть також бути одержані методами біотехнології рослин, зокрема генної інженерії. Особливо доцільний спосіб одержання андростерильних рослин описаний у публікації WO 89/10396, в якому, наприклад, рибонуклеазу, таку як барназу, селективно експримують у клітинах тапетуму тичинок. В цьому випадку фертильність може бути відновлена шляхом експресії інгібітору рибонуклеази, такого як барстар, у клітинах тапетуму.

Рослинами або сортами рослин (одержаними методами біотехнології рослин, зокрема генної інженерії), які можуть бути оброблені згідно з винаходом, є толерантні до гербіцидів рослини, тобто рослини, які були зроблені толерантними до одного або кількох конкретних гербіцидів. Такі рослини можуть бути одержані або шляхом генетичної трансформації, або шляхом селекції рослин, які містять мутацію, що надає їм відповідну толерантність до гербіцидів.

Толерантними до гербіцидів рослинами є, наприклад, толерантні до гліфосатів рослини, тобто рослини, які були зроблені толерантними до гербіциду гліфосат або його солей. Наприклад, толерантні до гліфосату рослини можуть бути одержані шляхом трансформації рослини за допомогою гену, який кодує фермент 5-енол-пірувілшикімат-3-фосфатсинтазу (ЕПШФС). Прикладами таких ЕПШФС-генів є ген *AroA* (Mutante СТ7) бактерії *Salmonella typhimurium*, ген *CP4* бактерії *Agrobacterium* sp., гени, які кодують ЕПШФС з петунії, томату або дагуси). Може бути застосована також мутована ЕПШФС. Толерантні до гліфосатів рослини можуть бути одержані також шляхом експримації гену, який кодує фермент гліфосат-оксидоредуктазу. Толерантні до гліфосатів рослини можуть бути одержані також шляхом експримації гену, який кодує фермент гліфосат-ацетилтрансферазу. Толерантні до гліфосатів рослини можуть бути одержані також шляхом селекції рослин, які містять природні мутації вищезазначених генів.

Іншими резистентними до гербіцидів рослинами є, наприклад, рослини, що були зроблені толерантними до гербіцидів, які інгібують фермент глутамінсинтазу, такі як біалафос, фосфінотрицин або глуфосинат. Такі рослини можуть бути одержані шляхом експресії ферменту, який детоксифікує гербіцид або мутант ферменту глутамінсинтаза, що є стійким до інгібування. Таким ефективним детоксифікуючим ферментом є, наприклад, фермент, що містить ген, який кодує фосфінотрицин-ацетилтрансферазу (наприклад, *bar* або *pat* ген, виділений із грибів роду *Streptomyces*). Рослини, в яких відбувається експресія екзогенної фосфінотрицин-ацетилтрансферази, описані в літературі.

Іншими толерантними до гербіцидів рослинами є також рослини, що були зроблені толерантними до гербіцидів, які пригнічують фермент гідроксифенілпіруватдіоксигеназу (ГФПД). Гідроксифенілпіруватдіоксигенази є ферментами, що каталізують реакцію, в процесі здійснення якої пара-гідроксифенілпіруват (ГФП) перетворюється на гомогентизат. Рослини, які є толерантними до інгібіторів ГФПД, можуть бути трансформовані за допомогою гену, який кодує природний резистентний фермент ГФПД, або гену, який кодує мутований фермент ГФПД. Толерантність до інгібіторів ГФПД може бути досягнута також шляхом трансформації рослин за допомогою генів, що кодують певні ферменти, які уможливають утворення гомогентизату попри пригнічення природного ферменту ГФПД інгібіторами ГФПД. Толерантність рослин до інгібіторів ГФПД можна покращити також шляхом додаткового трансформування рослин за допомогою гену, що кодує ГФПД-толерантний фермент, із застосуванням гену, що кодує фермент префенатдегідрогеназу.

Іншими резистентними до гербіцидів рослинами є рослини, які були зроблені толерантними до інгібіторів ацетолактатсинтази (АЛС). До відомих інгібіторів АЛС належать, наприклад, сульфонілсечовина, імідазоліон, триазолопіримідин, піримідинілокси(тіо)бензоат та/або гербіциди на основі сульфоніламінокарбоніл-триазоліону. Відомо, що різні мутації у ферменті АЛС (відомому також як синтаза ацетогідрокислоти, АГКС) надають рослинам толерантності до різних гербіцидів чи груп гербіцидів. Одержання рослин, толерантних до сульфонілсечовини, і рослин, толерантних до імідазоліону, описано в міжнародній патентній заявці WO 1996/033270. Інші рослини, толерантні до сульфонілсечовини та імідазоліону, описані також, наприклад, у публікації WO 2007/024782.

Інші рослини, толерантні до імідазоліону та/або сульфонілсечовини, можуть бути одержані методами індукованого мутагенезу, селекції клітинних культур у присутності гербіциду або мутаційної селекції.

Рослинами або сортами рослин (одержаними методами біотехнології рослин, зокрема генної інженерії), які також можуть бути оброблені згідно з винаходом, є стійкі до ушкодження комахами трансгенні рослини, тобто рослини, які були зроблені стійкими до ураження певними цільовими комахами. Такі рослини можуть бути одержані шляхом генетичної трансформації або селекції рослин, що містять мутацію, яка надає такої стійкості до ураження комахами.

Поняття "стійка до ураження комахами трансгенна рослина" охоплює в цьому зв'язку всі рослини, які містять принаймні один трансген, що включає послідовність кодів, яка кодує зазначені далі білки:

1) інсектицидний кристалічний білок із *Bacillus thuringiensis* або його інсектицидну частину, такі як, наприклад, інсектицидні кристалічні білки, з описом яких можна ознайомитися в режимі

он-лайн за адресою:

http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/

або їх інсектицидні частини, наприклад білки Cry-класів Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Ae або Cry3Bb, або їх інсектицидні частини; або

5 2) кристалічний білок із *Bacillus thuringiensis* або його частину, що в присутності другого, іншого кристалічного білка, ніж із *Bacillus thuringiensis*, або його частини проявляє інсектицидну дію, такий як бінарний токсин, що складається з кристалічних білків Cy34 та Cy35; або

3) інсектицидний гібридний білок, який включає частини двох різних інсектицидних кристалічних білків із *Bacillus thuringiensis*, як, наприклад, гібрид білків за попереднім пунктом 1) або гібрид білків за попереднім пунктом 2), наприклад білок Cry1A.105, який синтезується трансгенною кукурудзою, трансформаційна подія MON98034 (WO 2007/027777); або

4) білок за будь-яким із попередніх пунктів 1) - 3), в якому кілька, зокрема від 1 до 10 амінокислот заміщені однією іншою амінокислотою для досягнення вищої інсектицидної ефективності проти цільового виду комах та/або розширення спектру дії на відповідні цільові види комах, та/або внаслідок змін, які були індуковані в кодуючій ДНК в процесі клонування або трансформації, такі як білок Cry3Bb1 у трансгенній кукурудзі, трансформаційна подія MON863 або MON88017, або білок Cry3A у трансгенній кукурудзі, трансформаційна подія MIR 604; або;

5) інсектицидний секретований білок із *Bacillus thuringiensis* або *Bacillus cereus*, або його інсектицидну частину, такий як вегетативні інсектицидні білки (vegetative insecticidal proteins, VIP), наведені в переліку в мережі Інтернет на сайті http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, наприклад, білки класу VIP3Aa; або

6) секретований білок із *Bacillus thuringiensis* або *Bacillus cereus*, який в присутності другого секретованого білка з *Bacillus thuringiensis* або *B. cereus* діє як інсектицид, такий як бінарний токсин, що складається з білків VIP1A та VIP2A; або

7) інсектицидний гібридний білок, що включає частини різних секретованих білків із *Bacillus thuringiensis* або *Bacillus cereus*, такий як гібрид білків за попереднім пунктом 1) або гібрид білків за попереднім пунктом 2); або

8) білок за будь-яким із попередніх пунктів 1) - 3), в якому кілька, зокрема від 1 до 10 амінокислот замінені однією іншою амінокислотою для досягнення вищої інсектицидної ефективності проти цільового виду комах та/або розширення спектру дії на відповідний цільовий вид комах, та/або внаслідок змін, які були індуковані в кодуючій ДНК в процесі клонування або трансформації (причому кодування інсектицидного білка зберігається), такий як білок VIP3Aa у трансгенному бавовнику, трансформаційна подія COT 102.

35 Самозрозуміло, до стійких до ураження комахами трансгенних рослин у цьому зв'язку віднесені також усі рослини, що містять комбінацію генів, які кодують білки одного з вищезазначених класів від 1 до 8. В одній із форм виконання винаходу стійка до ураження комахами рослина містить більше одного трансгена, який кодує білок одного з вищезазначених класів від 1 до 8, для розширення спектру дії на відповідні цільові види комах або уповільнення процесу розвитку стійкості комах до інсектицидних властивостей рослин за рахунок застосування різних білків, які є отруйними саме для цього цільового виду комах, проте розрізняються за механізмом дії, наприклад блокуванням різних рецепторів комах.

40 Рослини або сорти рослин (одержані методами біотехнології рослин, зокрема генної інженерії), які також можуть бути оброблені згідно з винаходом, є толерантними до абіотичних стресорів. Такі рослини можуть бути одержані шляхом генетичної трансформації або селекції рослин, що містять мутацію, яка надає відповідної стресостійкості. До особливо корисних рослин, толерантних до стресів, належать:

а. Рослини, що містять трансген, спроможний зменшувати експресію та/або активність гену полі(АДФ-рібозо)полімерази (ПАРП) у клітинах рослин або рослинах.

50 б. Рослини, що містять трансген, стимулюючий розвиток толерантності до стресорів, спроможний зменшувати експресію та/або активність кодуючого ПАРП гену рослин або клітин рослин;

с. Рослини, що містять трансген, стимулюючий розвиток толерантності до стресорів, який кодує в рослинах функціональний фермент відновлення біосинтезу нікотинамідаденін-нуклеотиду, в тому числі нікотинамідази, нікотинат-фосфор-ібозилтрансферази, нікотинат-мононуклеотидаденіл-трансферази, нікотинамід-аденін-динуклеотид-синтетази або нікотинамід-фосфорібозилтрансферази.

60 Рослини або сорти рослин (одержані методами біотехнології рослин, зокрема генної інженерії), які також можуть бути оброблені згідно з винаходом, характеризуються зміненою кількістю, якістю та/або придатністю рослинницької продукції до зберігання, та/або зміненими

характеристиками певних складових рослинницької продукції, наприклад:

1) Трансгенні рослини, що синтезують модифікований крохмаль, хіміко-фізичні параметри якого, зокрема вміст амілози або співвідношення між амілозою та амілопектином, ступінь розгалуження, середня довжина ланцюга, розподіл бічних ланцюгів, динаміка в'язкості, міцність гелю, розмір та/або морфологія зерен змінені порівняно з крохмалем, синтезованим у клітинах або рослинах диких типів, таким чином, що цей модифікований крохмаль виявляється краще придатним для застосування в окремих галузях.

2) Трансгенні рослини, що синтезують некрохмальні вуглеводневі полімери або некрохмальні вуглеводневі полімери, характеристики яких порівняно з рослинами вихідних типів змінені без генетичної модифікації. Прикладами є рослини, що виробляють поліфруктозу, зокрема типу інуліну та левану, рослини, що виробляють альфа-1,4-глюкан, рослини, що виробляють альфа-1,6-розгалужені альфа-1,4-глюкани, і рослини, що виробляють альтернан.

3) Трансгенні рослини, які виробляють гіалуронан.

Рослинами або сортами рослин (одержаними методами біотехнології рослин, зокрема генної інженерії), які також можуть бути оброблені згідно з винаходом, є рослини бавовника зі зміненими властивостями волокон. Такі рослини можуть бути одержані шляхом генетичної трансформації або шляхом селекції рослин, які містять мутацію, що надає такі змінені властивості волокнам; до них належать:

a) рослини бавовника, які містять змінену форму генів целюлозосинтази,

b) рослини бавовника, які містять змінену форму *gsw2*- або *gsw3*-гомолгів нуклеїнових кислот;

c) рослини бавовника з підвищеною експресією сахарозофосфатсинтази;

d) рослини бавовника з підвищеною експресією сахарозсинтази;

e) рослини бавовника, у яких змінений момент керування процесом пропускання плазмодесмами у основи волокнини, наприклад внаслідок зменшення кількості волоконно-селективної β -1,3-глюканаз;

f) рослини бавовника зі зміненою реакційною здатністю волокон, наприклад шляхом експресії гена N-ацетилглюкозамінотрансферази, в тому числі також *nodC*, та генів хітинсинтази.

Рослинами або сортами рослин (одержаними методами біотехнології рослин, зокрема генної інженерії), які також можуть бути оброблені згідно з винаходом, є рапс або споріднені рослини з роду капусти (*Brassica*) зі зміненим складом олії. Такі рослини можуть бути одержані шляхом генетичної трансформації або шляхом селекції рослин, які містять мутацію, що спричиняє такі зміни складу олії; до них належать:

a) рослини рапсу, що виробляють олію зі збільшеним вмістом масляних кислот;

b) рослини рапсу, що виробляють олію зі зменшеним вмістом ліноленової кислоти.

c) рослини рапсу, що виробляють олію з низьким вмістом насичених жирних кислот.

Особливо корисними трансгенними рослинами, які можуть бути оброблені згідно з винаходом, є рослини, які містять один чи кілька генів, що кодуєть один чи кілька токсинів, а саме трансгенні рослини, які є комерційно доступними за фірмовими найменуваннями: YIELD GARD® (наприклад кукурудза, бавовник, соя), KnockOut® (наприклад кукурудза), BiteGard® (наприклад кукурудза), BT-Xtra® (наприклад кукурудза), StarLink® (наприклад кукурудза), Bollgard® (бавовник), Nucotn® (бавовник), Nucotn 33B® (бавовник), NatureGard® (наприклад кукурудза), Protecta® та NewLeaf® (картопля). Прикладами стійких до гербіцидів рослин є сорти кукурудзи, бавовника та сої, які є комерційно доступними за фірмовими найменуваннями: Roundup Ready® (стійкість до гліфосатів, наприклад кукурудза, бавовник, соя), Liberty Link® (стійкість до фосфінотрицину, наприклад рапс), IMI® (стійкість до імідазолінонів) та STS® (стійкість до сульфонілсечовини), наприклад кукурудза. Стійкими до гербіцидів (вирощеними традиційними способами як стійкі до гербіцидів) рослинами є також сорти, які є комерційно доступними за найменуванням Clearfield® (наприклад кукурудза).

Особливо корисними трансгенними рослинами, які можуть бути оброблені згідно з винаходом, є рослини, що містять трансформаційну подію або комбінацію трансформаційних подій, і включені, наприклад, у бази даних відповідних національних або регіональних відомств (див., наприклад, http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx та <http://www.agbios.com/dbase.php>).

Окрім цього, відповідні винаходи активні речовини чи засоби можуть бути також використані для захисту технічних матеріалів від ураження і руйнування шкідливими мікроорганізмами, наприклад грибами і комахами.

Окрім цього, відповідні винаходів сполуки можуть бути застосовані поодиночі або в комбінаціях із іншими активними речовинами як засоби, що запобігають біологічному обростанню підводних споруд (англ. Antifouling).

Поняття "технічні матеріали" в цьому зв'язку означає неживі матеріали, що були виготовлені для застосування у техніці. Відповідними прикладами технічних матеріалів, які за допомогою відповідних винаходів активних речовин мають бути захищені від мікробного пошкодження або знищення, є клейові матеріали, клеї тваринного походження, папір, стінний ізоляційний (будівельний) картон та інші види картону, текстильні вироби, килими, шкіра, деревина, лакофарбові та полімерні матеріали, мастильно-охолоджувальні засоби та інші матеріали, які можуть бути пошкоджені або знищені мікроорганізмами. Як матеріали, що мають бути захищені, слід вказати також частини виробничих установок, наприклад контури циркуляції охолоджувальної води, системи охолодження та опалення, а також системи вентиляції та кондиціонування повітря, функціонування яких може бути порушене внаслідок розмноження мікроорганізмів. У рамках цього винаходу технічними матеріалами є переважно клейові матеріали, клеї тваринного походження, папір і картон, шкіра, деревина, лакофарбові матеріали, мастильно-охолоджувальні засоби та рідкі теплоносії, особливо переважно - деревина. Застосування відповідних винаходів активних речовин або засобів дозволяє запобігти таким негативним ефектам, як гниття, розклад, вицвітання, знебарвлення або пліснявіння. Крім цього, відповідні винаходи сполуки можуть бути застосовані для захисту від обростання предметів, зокрема корпусів суден, фільтрів, рибальських сітей, будівельних, портових та сигнальних споруд, які контактують з морською водою або морською водою, змішаною з прісною.

Відповідний винаходу спосіб боротьби зі шкідливими грибами можна застосовувати також для захисту так званих "складованих товарів" (Storage Goods). Поняття "складовані товари" при цьому охоплює природні речовини рослинного або тваринного походження, або продукти їх переробки, які одержують в природі, довготривалий захист яких необхідно забезпечити. Складовані товари рослинного походження, наприклад рослини або частини рослин, такі як стебла, листя, бульби, насіння, плоди, зерна, можна захищати безпосередньо після збирання врожаю або після обробки шляхом (попереднього) висушування, зволоження, подрібнення, перемелювання, пресування або обсмажування. Поняття "складовані товари" охоплює також ділову деревину, необроблену, таку як будівельний лісоматеріал, опори повітряних ліній електропередачі та шлакбауми, або в формі готових продуктів, таких як меблі. Складованими товарами тваринного походження є, наприклад, шкури, вироблена шкіра, хутро та щетина. Застосування відповідних винаходів активних речовин забезпечує можливість запобігання негативним ефектам, таким як гниття, розклад, вицвітання, знебарвлення або пліснявіння.

Далі як приклади, які не обмежують винахід, наведені деякі збудники грибкових захворювань, обробку проти яких можна здійснювати згідно з винаходом:

- 35 захворювання, спричинені збудниками справжньої борошнистої роси, такими як види *Blumeria*, наприклад *Blumeria graminis*;
- види *Podosphaera*, наприклад *Podosphaera leucotricha*;
- види *Sphaerotheca*, наприклад *Sphaerotheca fuliginea*;
- види *Uncinula*, наприклад *Uncinula necator*;
- 40 захворювання, спричинені збудниками іржі, такими як види *Gymnosporangium*, наприклад *Gymnosporangium sabinae*;
- види *Hemileia*, наприклад *Hemileia vastatrix*;
- види *Phakopsora*, наприклад *Phakopsora pachyrhizi* та *Phakopsora meibomia*;
- види *Puccinia*, наприклад *Puccinia recondita* або *Puccinia triticina*;
- 45 види *Uromyces*, наприклад *Uromyces appendiculatus*;
- захворювання, спричинені збудниками, які належать до групи ооміцетів, такими як види *Bremia*, наприклад *Bremia lactucae*;
- види *Peronospora*, наприклад *Peronospora pisi* або *P. brassicae*;
- види *Phytophthora*, наприклад *Phytophthora infestans*;
- 50 види *Plasmopara*, наприклад *Plasmopara viticola*;
- види *Pseudoperonospora*, наприклад *Pseudoperonospora humuli* або *Pseudoperonospora cubensis*;
- види *Pythium*, наприклад *Pythium ultimum*;
- плямистість та в'янення листя, спричинені, наприклад,
- 55 видами *Alternaria*, наприклад *Alternaria solani*;
- видами *Cercospora*, наприклад *Cercospora beticola*;
- видами *Cladosporium*, наприклад *Cladosporium cucumerinum*;
- видами *Cochliobolus*, наприклад *Cochliobolus sativus* (конідіальна форма: дрекслера (Drechslera), син.: гелмінтоспоріум (*Helminthosporium*));
- 60 видами *Colletotrichum*, наприклад *Colletotrichum lindemuthianum*;

- видами *Cycloconium*, наприклад *Cycloconium oleaginum*;
 видами *Diaporthe*, наприклад *Diaporthe citri*;
 видами *Elsinoe*, наприклад *Elsinoe fawcettii*;
 видами *Gloeosporium*, наприклад *Gloeosporium laeticolor*;
 5 видами *Glomerella*, наприклад *Glomerella cingulata*;
 видами *Guignardia*, наприклад *Guignardia bidwelli*;
 видами *Leptosphaeria*, наприклад *Leptosphaeria maculans*;
 видами *Magnaporthe*, наприклад *Magnaporthe grisea*;
 видами *Microdochium*, наприклад *Microdochium nivale*;
 10 видами *Mycosphaerella*, наприклад *Mycosphaerella graminicola* та *M. fijiensis*;
 видами *Phaeosphaeria*, наприклад *Phaeosphaeria nodorum*;
 видами *Pyrenophora*, наприклад *Pyrenophora teres*;
 видами *Ramularia*, наприклад *Ramularia collo-cygni*;
 видами *Rhynchosporium*, наприклад *Rhynchosporium secalis*;
 15 видами *Septoria*, наприклад *Septoria apii*;
 видами *Typhula*, наприклад *Typhula incarnata*;
 видами *Venturia*, наприклад *Venturia inaequalis*;
 захворювання коренів та стебел, спричинені, наприклад,
 видами *Corticium*, наприклад *Corticium graminearum*;
 20 видами *Fusarium*, наприклад *Fusarium oxysporum*;
 видами *Gaeumannomyces*, наприклад *Gaeumannomyces graminis*;
 видами *Rhizoctonia*, наприклад *Rhizoctonia solani*;
 видами *Tapesia*, наприклад *Tapesia acuformis*;
 видами *Thielaviopsis*, наприклад *Thielaviopsis basicola*;
 25 захворювання колосся та волотей (включаючи качани кукурудзи), спричинені, наприклад,
 видами *Alternaria*, наприклад *Alternaria spp.*;
 видами *Aspergillus*, наприклад *Aspergillus flavus*;
 видами *Cladosporium*, наприклад *Cladosporium cladosporioides*;
 видами *Claviceps*, наприклад *Claviceps purpurea*;
 30 видами *Fusarium*, наприклад *Fusarium culmorum*;
 видами *Gibberella*, наприклад *Gibberella zeae*;
 видами *Monographella*, наприклад *Monographella nivalis*;
 видами *Septoria*, наприклад *Septoria nodorum*;
 захворювання, спричинені сажками, такими як
 35 види *Sphacelotheca*, наприклад *Sphacelotheca reiliana*;
 види *Tilletia*, наприклад *Tilletia caries*, *T. controversa*;
 види *Urocystis*, наприклад *Urocystis occulta*;
 види *Ustilago*, наприклад *Ustilago nuda*, *U. nuda tritici*;
 плодова гниль, спричинена, наприклад,
 40 видами *Aspergillus*, наприклад *Aspergillus flavus*;
 видами *Botrytis*, наприклад *Botrytis cinerea*;
 видами *Penicillium*, наприклад *Penicillium expansum* та *P. purpurogenum*;
 видами *Sclerotinia*, наприклад *Sclerotinia sclerotiorum*;
 видами *Verticillium*, наприклад *Verticillium alboatrum*;
 45 гниль та в'янення внаслідок інфекції, переданої через насіння та ґрунт,
 а також захворювання сіянців, спричинені, наприклад,
 видами *Fusarium*, наприклад *Fusarium culmorum*;
 видами *Phytophthora*, наприклад *Phytophthora cactorum*;
 видами *Pythium*, наприклад *Pythium ultimum*;
 50 видами *Rhizoctonia*, наприклад *Rhizoctonia solani*;
 видами *Sclerotium*, наприклад *Sclerotium rolfsii*;
 ракові захворювання, гали та "відьомські мітли", спричинені, наприклад,
 видами *Nectria*, наприклад *Nectria galligena*;
 в'янення, спричинене, наприклад
 55 видами *Monilinia*, наприклад *Monilinia laxa*;
 деформації листя, квітів і плодів, спричинені, наприклад,
 видами *Taphrina*, наприклад *Taphrina deformans*;
 дегенеративні захворювання дерев'янистих рослин, спричинені, наприклад,
 видами *Esca*, наприклад *Phaemoniella clamydospora* та *Phaeoacremonium aleophilum*, а також
 60 *Fomitiporia mediterranea*;

- захворювання квітів і насіння, спричинені, наприклад, видами *Botrytis*, наприклад *Botrytis cinerea*;
захворювання бульб рослин, спричинені, наприклад, видами *Rhizoctonia*, наприклад *Rhizoctonia solani*;
5 видами *Helminthosporium*, наприклад *Helminthosporium solani*;
захворювання, спричинені бактеріальними збудниками, такими як види *Xanthomonas*, наприклад *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;
види *Pseudomonas*, наприклад *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;
види *Erwinia*, наприклад *Erwinia amylovora*.
10 Переважно можна подолати такі хвороби сої:
грибкові захворювання листя, стебел, стручків та насіння, спричинені, наприклад, *Alternaria leaf spot* (*Alternaria spec. atrans tenuissima*),
Anthrachnose (*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*),
Brown spot (*Septoria glycines*),
15 *Cercospora leaf spot* та *blight* (*Cercospora kikuchii*),
Choanephora leaf blight (*Choanephora infundibulifera trispora* (син.)),
Dactuliophora leaf spot (*Dactuliophora glycines*),
Downy Mildew (*Peronospora manshurica*),
Drechslera blight (*Drechslera glycini*),
20 *Frogeye Leaf spot* (*Cercospora sojae*),
Leptosphaerulina Leaf Spot (*Leptosphaerulina trifolii*),
Phyllosticta Leaf Spot (*Phyllosticta sojaecola*),
Pod and Stem Blight (*Phomopsis sojae*),
Powdery Mildew (*Microsphaera diffusa*),
25 *Pyrenochaeta Leaf Spot* (*Pyrenochaeta glycines*),
Rhizoctonia Aerial, Foliage, та Web Blight (*Rhizoctonia solani*),
Rust (*Phakopsora pachyrhizi*, *Phakopsora meibomia*),
Scab (*Sphaceloma glycines*),
Stemphylium Leaf Blight (*Stemphylium botryosum*),
30 *Target Spot* (*Corynespora cassicola*).
Грибкові захворювання коренів та основи стебел, спричинені, наприклад:
Black Root Rot (*Calonectria crotalariae*),
Charcoal Rot (*Macrophomina phaseolina*),
Fusarium Blight або *Wilt, Root Rot, та Pod i Collar Rot*
35 (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium orthoceras*, *Fusarium semitectum*, *Fusarium equiseti*), *Mycolepto discus Root Rot* (*Mycoleptodiscus terrestris*),
Neocosmospora (*Neocosmospora vasinfecta*),
Pod and Stem Blight (*Diaporthe phaseolorum*),
Stem Canker (*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*),
40 *Phytophthora Rot* (*Phytophthora megasperma*),
Brown Stem Rot (*Phialophora gregata*),
Pythium Rot (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium irregulare*, *Pythium debaryanum*,
Pythium myriotylum, *Pythium ultimum*),
Rhizoctonia Root Rot, Stem Decay, та Damping-Off (*Rhizoctonia solani*),
45 *Sclerotinia Stem Decay* (*Sclerotinia sclerotiorum*),
Sclerotinia Southern Blight (*Sclerotinia rolfii*),
Thielaviopsis Root Rot (*Thielaviopsis basicola*).
Мікроорганізмами, які можуть спричинити руйнування або зміни властивостей технічних матеріалів, є, наприклад, бактерії, гриби, дріжджі, водорості та слизисті організми. Переважно
50 відповідні винаходів активні речовини є ефективними проти грибів, зокрема пліснявих грибів, грибів, що змінюють колір деревини і руйнують деревину (базидіоміцетів), а також проти слизистих організмів та водоростей.
Слід навести деякі приклади мікроорганізмів таких родів:
55 *Alternaria*, зокрема *Alternaria tenuis*;
Aspergillus, зокрема *Aspergillus niger*;
Chaetomium, зокрема *Chaetomium globosum*;
Coniophora, зокрема *Coniophora puetana*;
Lentinus, зокрема *Lentinus tigrinus*;
Penicillium, зокрема *Penicillium glaucum*;
60 *Polyporus*, зокрема *Polyporus versicolor*;

Aureobasidium, зокрема *Aureobasidium pullulans*;
 Sclerophoma, зокрема *Sclerophoma pityophila*;
 Trichoderma, зокрема *Trichoderma viride*;
 Escherichia, зокрема *Escherichia coli*;
 5 Pseudomonas, зокрема *Pseudomonas aeruginosa*;
 Staphylococcus, зокрема *Staphylococcus aureus*.

Окрім цього, відповідні винаходові активні речовини проявляють також дуже високу протигрибкову активність. Вони мають дуже широкий спектр протигрибкової дії, зокрема проти дерматофітів і бластомицетів, плісняви та двофазних грибів (наприклад проти видів *Candida*, таких як *Candida albicans*, *Candida glabrata*), а також *Epidermophyton floccosum*, видів *Aspergillus*, таких як *Aspergillus niger* та *Aspergillus fumigatus*, видів *Trichophyton*, таких як *Trichophyton mentagrophytes*, видів *Microsporon*, таких як *Microsporon canis* та *audouinii*. Наведений лише для пояснення перелік грибів в жодному разі не обмежує спектр протигрибкової дії відповідних винаходові активних речовин.

15 Тому відповідні винаходові активні речовини можуть бути застосовані як у галузі медицини, так і в інших, немедичних галузях.

При застосуванні відповідних винаходові активних речовин як фунгіцидів норми витрати залежно від способу застосування можуть варіювати в широкому діапазоні. Норма витрати відповідних винаходові активних речовин становить:

20 при обробці частин рослин, наприклад листя: від 0,1 до 10 000 г/га, переважно від 10 до 1 000 г/га, особливо переважно від 50 до 300 г/га (при застосуванні шляхом обливання або крапельного зрошення норму витрати можна навіть зменшувати, насамперед у разі застосування інертних субстратів, таких як кам'яна вовна або перліт);

25 при обробці посівного матеріалу: від 2 до 200 г на 100 кг посівного матеріалу, переважно від 3 до 150 г на 100 кг посівного матеріалу, особливо переважно від 2,5 до 25 г на 100 кг посівного матеріалу, цілком переважно від 2,5 до 12,5 г на 100 кг посівного матеріалу;

при обробці ґрунту: від 0,1 до 10 000 г/га, переважно від 1 до 5 000 г/га.

Ці норми витрати наведені лише як приклади і не є обмежувальними в сенсі винаходу.

Отже, відповідні винаходу активні речовини або засоби можуть бути застосовані для захисту 30 рослин протягом певного періоду часу після обробки від ураження зазначеними збудниками хвороб. Період часу, протягом якого забезпечується такий захист, у загальному випадку становить від 1 до 28 діб, переважно від 1 до 14 діб, особливо переважно від 1 до 10 діб, цілком переважно від 1 до 7 діб після обробки рослин активними речовинами чи до 200 діб після обробки посівного матеріалу.

35 Окрім цього, шляхом відповідної винаходові обробки можна зменшити вміст мікотоксинів у рослинницькій продукції та у виготовлених з неї продуктах харчування і кормах. При цьому слід особливо, але не виключно, назвати такі мікотоксини: деоксиніваленол (ДОН), ніваленол, 15-Ас-DON, 3-Ас-DON, T2- та HT2-токсин, фумонізін, цеараленон, моніліформін, фузарин, діацетооксисцирленол (ДАС), боверицин, енніатин, фузаропроліферин, фузаренол, 40 охратоксини, патулін, алкалоїди ріжків та афлатоксини, які, наприклад, можуть бути утворені такими грибами: *Fusarium spec.*, такими як *Fusarium acuminatum*, *F. avenaceum*, *F. crookwellense*, *F. culmorum*, *F. graminearum* (*Gibberella zeae*), *F. equiseti*, *F. fujikoro*, *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*, 45 *F. verticillioides* тощо, а також *Aspergillus spec.*, *Penicillium spec.*, *Claviceps purpurea*, *Stachybotrys spec.* тощо.

Відповідні винаходу сполуки в разі необхідності в певних концентраціях чи з дотриманням певних норм витрати можуть бути також застосовані також як гербіциди, антидоти, регулятори 50 росту або засоби для покращання властивостей рослин, або як мікробіциди, наприклад як фунгіциди, протигрибкові засоби, бактерициди, вірициди (включаючи засоби проти віроїдів), або як засоби проти MLO (мікоплазмоподібних організмів, англ. *Mycoplasma-like-organism*) та RLO (подібних до рикетсій організмів, англ. *Rickettsia-like-organism*). Їх можна також у разі необхідності застосовувати як проміжні чи вихідні продукти для синтезу інших активних речовин.

55 Відповідні винаходові активні речовини впливають на метаболізм рослин і тому можуть бути використані також як регулятори росту.

Регулятори росту рослин можуть впливати на різні аспекти їх розвитку. Дія цих речовин залежить в основному від моменту їх застосування відносно стадії розвитку рослини, а також від нанесеної на рослини або їх оточення кількості активних речовин і способу застосування. В 60 кожному випадку регулятори росту мають впливати на культурні рослини певним бажаним

чином.

Речовини, які регулюють ріст рослин, можуть бути застосовані, наприклад, для уповільнення вегетативного росту рослин. Подібне уповільнення росту, зокрема трав, має економічне значення, оскільки завдяки цьому можна зменшити частоту підстригання газонів у декоративних садах, парках і спортивних спорудах, на узбіччях доріг, в аеропортах або фруктових садах. Значення має також уповільнення росту трав'янистих і дерев'янистих рослин на узбіччях доріг і поблизу трубопроводів або ліній електропередачі, або взагалі в тих зонах, де інтенсивне відростання рослин є небажаним.

Важливим є також застосування регуляторів росту для уповільнення процесу видовження стебел злаків. Це дозволяє зменшити або повністю усунути ризик надламу рослин при згинанні ("полягання") перед збиранням врожаю. Крім цього, регулятори росту можуть спричиняти потовщення стебел злаків, що також протидіє поляганню. Застосування регуляторів росту для скорочення і потовщення стебел дозволяє вносити більшу кількість добрив для підвищення врожаю без ризику полягання зернових культур.

Уповільнення вегетативного росту дозволяє збільшити густину насаджень багатьох культурних рослин і завдяки цьому досягти підвищеної врожайності відносно площі засадженого ґрунту. Перевагою одержуваних таким чином менших рослин є полегшення процесів обробки культури і збирання врожаю.

Уповільнення вегетативного росту рослин може сприяти підвищенню врожайності також за рахунок того, що позитивний вплив живильних речовин і асимілятів на утворення квітів і плодів є більш інтенсивним, ніж на вегетативні частини рослин.

Застосування регуляторів росту часто дозволяє також стимулювати вегетативний ріст. Цей ефект є дуже корисним в тому випадку, якщо рослинницькою продукцією є вегетативні частини рослин. Проте, стимулювання вегетативного росту може одночасно спричинити і стимулювання генеративного росту, внаслідок чого утворюється більше асимілятів, і в результаті зростає кількість або розмір плодів.

Збільшення врожайності у деяких випадках можна досягти шляхом втручання у метаболізм рослин без помітних змін вегетативного росту. Крім цього, за допомогою регуляторів росту можна досягти зміни складу рослин, що, в свою чергу, може спричинити поліпшення якості продуктів рослинництва. Можна, наприклад, збільшити вміст цукру в цукровому буряку, цукровій тростині, ананасах, а також цитрусових, або вміст білків у сої чи злаках. Можливим є також, наприклад, уповільнення процесу розкладу корисних компонентів, наприклад цукру в цукровому буряку або в цукровій тростині, за допомогою регуляторів росту до або після збирання врожаю. Крім цього, можливим є здійснення позитивного впливу на продукування або відтік вторинних продуктів життєдіяльності рослин. Прикладом є стимулювання витікання латексу з каучуконосних рослин.

Під впливом регуляторів росту може відбуватися утворення партенокарпічних (безнасінних) плодів. Окрім цього, можна впливати на стать квітів. Можна також досягти стерильності пилку, що є дуже важливим для селекції та одержання гібридного посівного матеріалу.

За допомогою регуляторів росту можна керувати галуженням рослин. Із однієї сторони, шляхом порушення верхівкового домінування можна стимулювати розвиток бічних пагонів, що може бути дуже корисним особливо у декоративному квітникарстві, також у поєднанні з уповільненням росту. Проте, з іншої сторони, можна також уповільнювати ріст бічних пагонів. Такий ефект є дуже корисним, наприклад, у тютюнництві або в розведенні томатів.

За допомогою регуляторів росту можна регулювати листовий покрив рослин таким чином, щоб забезпечити їх дефоліацію в бажаний момент часу. Подібне видалення листя є дуже важливим при механічному збиранні врожаю бавовника, проте є корисним і для інших культур, наприклад у виноградарстві, для полегшення цього процесу. Дефоліацію рослин можна також здійснювати для зменшення випаровування води рослинами перед пересаджуванням.

Регулятори росту також можуть бути застосовані для регулювання моменту опадання плодів. Із однієї сторони, можна запобігати передчасному опаданню плодів. Із іншої сторони, можна стимулювати процес опадання плодів або навіть облітання квітів до досягнення певного обсягу ("проріджування"), щоб припинити періодичність плодоношення. Періодичність плодоношення є своєрідною особливістю деяких видів фруктових дерев, спричинену ендегенними факторами, яка полягає в тому, що їх врожайність в різні роки значно відрізняється. Насамкінець застосування регуляторів росту дозволяє зменшити зусилля, необхідні для відокремлення плодів від рослини на момент збирання врожаю, щоб забезпечити можливість механізації процесу або полегшити ручну працю.

За допомогою регуляторів росту можна також прискорювати або уповільнювати процес досягання рослинницької продукції до або після збирання врожаю. Це є особливою перевагою,

оскільки забезпечує можливість оптимального узгодження з потребами ринку. Крім цього, регулятори росту в деяких випадках можуть поліпшувати забарвлення плодів. Окрім цього, за допомогою регуляторів росту можна також концентрувати в часі процес достигання. Таким чином створюються умови для того, щоб, наприклад, забезпечити можливість повністю механізованого або ручного збирання врожаю тютюну, томатів або кави за одну технологічну операцію.

Застосування регуляторів росту дозволяє також впливати на період спокою насінин або бруньок, таким чином, що рослини, наприклад ананас або декоративні рослини в садівництвах, проростають, випускають пагони або цвітуть у такі моменти, в які вони в нормальному випадку не проявляють готовності до цього. Затримка розбруньковування або проростання насінин під дією регуляторів росту може виявитися необхідною на морозонебезпечних територіях, щоб уникнути пошкодження внаслідок пізніх заморозків.

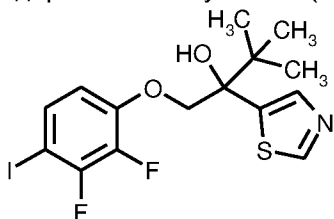
Насамкінець за допомогою регуляторів росту можна розвивати стійкість рослин проти морозу, сухості або високої солоності ґрунту. Це дозволяє культивувати рослин на територіях, які в звичайному випадку до цього не придатні.

Зазначені вище рослини можна особливо ефективно обробляти згідно з винаходом сполуками загальної формули (I) і відповідними винаходові засобами. Наведені для активних речовин та засобів переважні діапазони стосуються також обробки цих рослин. Особливо слід підкреслити ефективність обробки рослин спеціально зазначеними у цьому тексті сполуками і засобами.

Винахід пояснюється далі за допомогою наведених прикладів. Проте, винахід не обмежується наведеними прикладами.

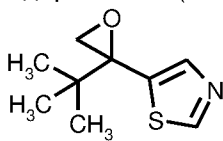
Приклади одержання

Одержання сполуки № 1 (Спосіб С)



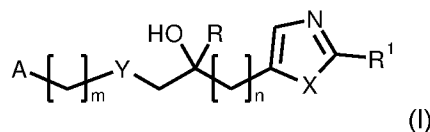
До 0,86 г (3,4 ммоль) 2,3-дифтор-4-йодфенолу, розчиненого в 10 мл N,N-диметилформаміду, при кімнатній температурі в атмосфері аргону додавали 0,13 г (60 %, 3,4 ммоль) гідриду натрію і перемішували реакційну суміш протягом 1 години при кімнатній температурі. Після цього додавали 0,56 г (3,0 ммоль) 5-(2-трет-бутилоксиран-2-іл)-1,3-тіазолу і перемішували реакційну суміш протягом 12 годин при 100 °С. Після охолодження до кімнатної температури видаляли розчинник під зниженим тиском і змішували залишок із насиченим водним розчином хлориду натрію, а також етилацетатом. Відокремлювали органічну фазу, висушували над сульфатом натрію, фільтрували і згущували. Потім вихідний продукт очищали методом колонкової хроматографії (циклогексан/етиловий естер оцтової кислоти 3:1). Одержали 0,04 г (3 %) цільового продукту.

Одержання 5-(2-трет-бутилоксиран-2-іл)-1,3-тіазолу



Для одержання застосовували метод, аналогічний описаному в публікації EP-A 0 409 418.

Таблиця 1



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

tBu = трет-бутил, MCP = 1-метилциклопропіл

5 Вимірювання значень logP здійснювали згідно з Директивою ЄЕС 79/831, Додатком V.A8, шляхом високоефективної рідинної хроматографії (HPLC, High Performance Liquid Chromatography) у колонках із оберненою фазою (C 18) за наведеною далі методикою:

10 [a] Визначення методом рідинної хроматографії/мас-спектрометрії (PX-MS) у кислому діапазоні здійснювали при pH = 2,7 із застосуванням 0,1 %-ного водного розчину мурашиної кислоти та ацетонітрилу (що містив 0,1 % мурашиної кислоти) як елюентів; лінійний градієнт від 10 % ацетонітрилу до 95 % ацетонітрилу.

Інші дані ЯМР для вибраних прикладів

15 Дані ¹H-ЯМР для наведених далі вибраних прикладів записані в формі таблиць піків ¹H-ЯМР. Для кожного піка сигналу спочатку наведене значення δ у млн.ч., а після нього через пробіл - значення інтенсивності сигналу в дужках. Пари чисел "значення δ (інтенсивність сигналу)" для різних піків сигналів відокремлені одна від іншої крапкою з комою. Тому таблиця піків для конкретного прикладу має таку форму:

δ₁ (інтенсивність₁); δ₂ (інтенсивність₂);; δ_i (інтенсивність_i);; δ_n (інтенсивність_n)

- Розчинник, в якому записували спектр ЯМР, зазначений у прямокутних дужках після номера прикладу і перед таблицею піків ЯМР. Деталізований опис відображення даних ЯМР у формі таблиць піків наведений у публікації "Citation of ЯМР Peaklist Data within Patent Applications" (див. видання Research Disclosure Database Number 564025, 2011, 16 березня 2011 р., або в файлі в мережі Інтернет (<http://www.rdelectronic.co.uk/rd/free/RD564025.pdf>)).

Приклад 10 [ДМСО- D_6] 8,9788 (3,80); 8,9775 (3,67); 7,8505 (4,51); 7,8490 (4,39); 7,4520 (3,16); 7,4303 (3,37); 6,7182 (2,50); 6,7114 (2,74); 6,6122 (1,66); 6,6054 (1,47); 6,5904 (1,57); 6,5836 (1,41); 5,6779 (4,88); 4,4771 (1,87); 4,4522 (2,27); 4,2521 (2,21); 4,2272 (1,85); 3,8394 (16,00); 3,3091 (73,39); 2,5226 (0,56); 2,5093 (6,46); 2,5049 (11,90); 2,5004 (15,51); 2,4960 (10,91); 2,4916 (5,34); 2,0849 (0,53); 1,0189 (0,38); 1,0055 (0,55); 0,9952 (0,98); 0,9808 (1,05); 0,9656 (11,36); 0,9258 (0,62); 0,9164 (0,76); 0,9129 (0,77); 0,9030 (0,89); 0,8928 (0,48); 0,8894 (0,48); 0,8796 (0,37); 0,3514 (0,46); 0,3418 (0,60); 0,3376 (0,62); 0,3285 (1,14); 0,3193 (0,74); 0,3148 (0,72); 0,3059 (0,53); 0,1629 (0,57); 0,1540 (0,72); 0,1496 (0,73); 0,1405 (1,14); 0,1315 (0,60); 0,1267 (0,58); 0,1176 (0,42); -0,0002 (2,12)

Приклад 11 [ДМСО- D_6] 8,9749 (2,05); 7,8618 (1,99); 7,8607 (1,98); 7,3679 (2,94); 5,7688 (3,02); 4,2956 (0,88); 4,2720 (1,06); 4,0848 (0,99); 4,0611 (0,85); 3,3252 (21,56); 3,3204 (19,55); 2,5191 (0,40); 2,5098 (9,86); 2,5056 (19,34); 2,5013 (27,16); 2,4970 (18,75); 2,4927 (9,26); 2,1861 (11,05); 0,9537 (16,00); -0,0002 (8,62)

Приклади застосування

- Приклад А: Тест на ефективність проти збудника *Alternaria* (плямистість листя у томатів) / захисна дія

Розчинник: 49 масових часток N,N-диметилацетаміду

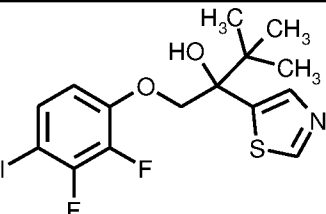
Емульгатор: 1 масова частка алкіларилполігліколевого етеру

- Для одержання цільової композиції активної речовини 1 масову частку активної речовини змішували із зазначеними кількостями розчинника та емульгатора і розбавляли концентрат водою до бажаної концентрації. Для перевірки ефективності захисту молоді рослини томатів обприскували композицією активної речовини із дотриманням зазначеної норми витрати. Через 1 добу після обробки рослини інокулювали суспензією спор *Alternaria solani*, після чого витримували протягом 24 годин при відносній вологості повітря 100 % і температурі 22 °С. Після цього рослини витримували при відносній вологості повітря 96 % і температурі 20 °С. Через 7 діб після інокуляції оцінювали результати обробки. При цьому ефективність захисної дії 0 % відповідала ефективності захисної дії для контрольного зразка, в той час як ефективність захисної дії 100 % означала відсутність ураження.

У цьому тесті наведені далі відповідні винаходіві сполуки при концентрації активної речовини 500 млн.ч. проявили ефективність захисної дії 70 % або вище.

Таблиця А

Тест на ефективність проти збудника *Alternaria* (плямистість листя у томатів) / захисна дія

№	Активна речовина	Норма витрати (млн.ч.)	Ефективність дії (%)
1		500	100

Приклад В: Тест для визначення ефективності проти збудника *Sphaerotheca* (справжня борошниста роса на огірках) / захисна дія

Розчинник: 49 масових часток N,N-диметилацетаміду

- Емульгатор: 1 масова частка алкіларилполігліколевого етеру

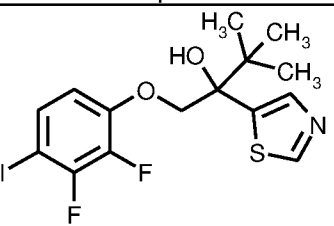
Для одержання цільової композиції активної речовини 1 масову частку активної речовини змішували із зазначеними кількостями розчинника та емульгатора і розбавляли концентрат водою до бажаної концентрації. Для перевірки ефективності захисту молоді рослини огірків обприскували композицією активної речовини із дотриманням зазначеної норми витрати. Через

- 1 добу після обробки рослини інокулювали суспензією спор *Sphaerotheca fuliginea*. Потім рослини встановлювали в теплицю і витримували при відносній вологості повітря 70 % і температурі 23 °С. Через 7 діб після інокуляції оцінювали результати обробки. При цьому ефективність захисної дії 0 % відповідала ефективності захисної дії для контрольного зразка, в той час як ефективність захисної дії 100 % означала відсутність ураження.

У цьому тесті наведені далі відповідні винаходіві сполуки при концентрації активної речовини 500 млн.ч. проявили ефективність захисної дії 70 % або вище.

Таблиця В

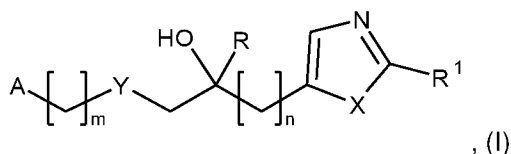
Тест для визначення ефективності проти збудника *Sphaerotheca* (справжня борошниста роса на огірках) / захисна дія

№	Активна речовина	Норма витрати (млн.ч.)	Ефективність дії (%)
1		500	94

10

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Гетероциклічні похідні алканолів формули (I)



15

в якій

X означає S,

Y означає O,

m означає 0,

n означає 0,

20

R означає лінійний або розгалужений C₃-C₇-алкіл, або незаміщений або заміщений галогеном або C₁-C₄-алкілом C₃-C₇-циклоалкіл,

R¹ означає водень, SH, C₁-C₄-алкілтію, C₁-C₄-алкокси або галоген,

A означає в кожному випадку тризаміщений Z феніл, причому замісники Z є однаковими або різними,

25

Z означає галоген, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкокси, C₁-C₄-алкілтію або C₁-C₄-галогеналкілтію,

а також їх агрохімічно активні солі з групи, що включає кислотно-адитивні солі та комплекси з солями металів.

2. Гетероциклічні похідні алканолів формули (I) за п. 1, в якій

30

X означає S,

Y означає O,

m означає 0,

n означає 0,

35

R означає трет-бутил, ізопропіл, 1-хлорциклопропіл, 1-фторциклопропіл або 1-метилциклопропіл,

R¹ означає водень,

A означає в кожному випадку тризаміщений Z феніл, причому замісники Z є однаковими або різними,

Z означає галоген, C₁-C₄-алкіл або C₁-C₄-галогеналкілтію.

40

3. Гетероциклічні похідні алканолів формули (I) за п. 1 або 2, в якій

X означає S,

Y означає O,

m означає 0,

п означає O,

R означає трет-бутил або 1-метилциклопропіл,

R¹ означає водень,

А означає в кожному випадку тризаміщений Z феніл, причому замісники Z є однаковими або різними,

Z означає галоген, C₁-C₄-алкіл або C₁-C₄галогеналкілтію.

4. Спосіб боротьби з фітопатогенними шкідливими грибами, який **відрізняється** тим, що гетероциклічні похідні алканолів формули (I) за будь-яким із пп. 1-3 наносять на фітопатогенні шкідливі гриби та/або їх життєвий простір.

10 5. Засіб для боротьби з фітопатогенними шкідливими грибами, який **відрізняється** тим, що містить принаймні одну з гетероциклічних похідних алканолів формули (I) за будь-яким із пп. 1-3 разом із розріджувачами та/або поверхнево-активними речовинами.

15 6. Засіб за п. 5, який **відрізняється** тим, що містить принаймні одну додаткову активну речовину, вибрану з групи, що включає інсектициди, атрактанти, стериланти, бактерициди, акарициди, нематодциди, фунгіциди, регулятори росту, гербіциди, добрива, антидоти і хімічні сигнальні речовини.

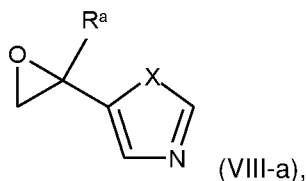
7. Застосування гетероциклічних похідних алканолів формули (I) за будь-яким із пп. 1-3 для боротьби з фітопатогенними шкідливими грибами.

20 8. Спосіб одержання засобів для боротьби з фітопатогенними шкідливими грибами, який **відрізняється** тим, що гетероциклічні похідні алканолів формули (I) за будь-яким із пп. 1-3 змішують із розріджувачами та/або поверхнево-активними речовинами.

9. Застосування гетероциклічних похідних алканолів формули (I) за будь-яким із пп. 1-3 для обробки трансгенних рослин.

25 10. Застосування гетероциклічних похідних алканолів формули (I) за будь-яким із пп. 1-3 для обробки посівного матеріалу, а також посівного матеріалу трансгенних рослин.

11. Похідні оксирану формули (VIII-a)



30 в якій

X означає S,

R^a означає в кожному випадку лінійний або розгалужений C₃-C₇-алкіл (за винятком трет-бутилу, якщо X означає S) або незаміщений або заміщений галогеном або C₁-C₄-алкілом C₃-C₇-циклоалкіл.

35

Комп'ютерна верстка А. Крулевський

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Василя Липківського, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

ДП "Український інститут інтелектуальної власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601