



УКРАЇНА

(19) UA (11) 78340 (13) C2
(51) МПК (2006)
C07C 233/65 (2007.01)
A01N 37/22

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИ

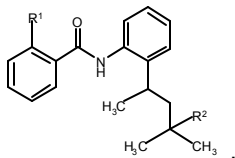
ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ

ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(54) ФЕНІЛБЕНЗАМІДИ ТА ЗАСІБ БОРОТЬБИ З НЕБАЖАНИМИ МІКРООРГАНІЗМАМИ НА ЇХ ОСНОВІ

1

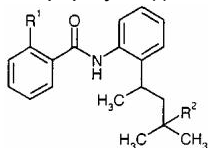
(21) а200500915
(22) 20.06.2003
(24) 15.03.2007
(86) РСТ/ЕР2003/006512, 20.06.2003
(31) 102 29 595.6
(32) 02.07.2002
(33) DE
(46) 15.03.2007, Бюл. № 3, 2007 р.
(72) Ельбе Ханс-Людвіг, DE, Рікк Хайко, DE, Дункель Ральф, DE, Райнеке Пауль, DE, Вахендорфф-Нойманн Ульріке, DE, Маулер-Махнік Астрід, DE, Кукк Карл-Хайнц, DE
(73) БАЄР КРОПСАСНС АГ, DE
(56) ЕР 0824099 А, 18.02.1998
ЕР 0545099 А, 09.06.1993
ЕР 0086111 А, 17.08.1983
WO 03010149 А, 06.02.2003
(57) 1. Фенілбензаміди формули (I)



Даний винахід стосується нових фенілбензамідів, способу їх одержання та їх застосування для боротьби з небажаними мікроорганізмами.

Вже відомо, що численні фенілбензаміди мають фунгіцидні властивості [див., наприклад, ЕР-А 0 545 099]. Так, наприклад, [з ЕР-А 0 545 099] відомі фенілбензаміди N-(2-гексилфеніл)-2-(трифторметил)бензамід та N-(2-гексилфеніл)-2-йодбензамід, хоча в цій патентній заявці немає інформації про їх біологічну активність.

Нещодавно були одержані нові фенілбензаміди формули (I)



(I)

в якій
R¹ означає трифторметил, хлор, бром або йод

та

2

в якій
R¹ означає трифторметил, хлор, бром або йод та
R² означає водень, метил або етил.
2. Фенілбензаміди формули (I) за п.1, в якій R² означає водень.
3. Фенілбензаміди формули (I) за п.1, вибрані із ряду
N-[2-(1,3-диметилбутил)феніл]-2-(трифторметил)бензамід,
N-[2-(1,3-диметилбутил)феніл]-2-хлорбензамід,
N-[2-(1,3-диметилбутил)феніл]-2-бромбензамід,
N-[2-(1,3-диметилбутил)феніл]-2-йодбензамід,
2-(трифторметил)-N-[2-(1,3,3-триметилбутил)феніл]бензамід,
2-хлор-N-[2-(1,3,3-триметилбутил)феніл]бензамід,
2-бром-N-[2-(1,3,3-триметилбутил)феніл]бензамід,
2-йод-N-[2-(1,3,3-триметилбутил)феніл]бензамід.
4. Засіб для боротьби з небажаними мікроорганізмами, який відрізняється тим, що містить щонайменше один фенілбензамід формули (I) за п. 1, а також розріджувачі та/або поверхнево-активні речовини.

R² означає водень або метил,
R² крім того означає етил.
Крім того з'ясували, що фенілбензаміди формули (I) одержують таким способом:
а) на першій стадії анілін піддають взаємодії з алкеном формули (II)



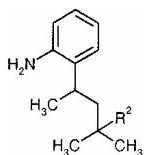
(II)

в якій
R² означає водень або метил,
R² крім того означає етил,
в присутності основи та в присутності кислоти Льюїса, а одержану таким чином похідну алкілфеніламіну формули (III)

(13) C2

(11) 78340

(19) UA

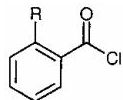


(III)

в якій

 R^2 означає водень або метил, R^2 крім того означає етил,

b) на другій стадії піддають взаємодії з бензоїлхлоридом формули (IV)



(IV)

в якій

 R^1 означає трифторметил, хлор, бром або йод,

в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоту, та, в разі необхідності, в присутності розріджувача.

Крім того з'ясували, що нові фенілбензаміди формули (I) мають дуже гарні мікробіцидні властивості та можуть бути застосовані у боротьбі з небажаними мікроорганізмами, а також для захисту рослин та матеріалів.

Несподівано виявили, що фенілбензаміди формули (I) згідно з винаходом проявляють значно кращу фунгіцидну активність, ніж схожі за структурою попередньо відомі активні речовини з подібним спектром дії.

Фенілбензаміди згідно з винаходом визначаються загальною формулою (I).

Перевагу надають фенілбензамідам формули (I), в якій R^2 означає водень.Перевагу надають фенілбензамідам формули (I), в якій R^2 означає метил.Перевагу надають фенілбензамідам формули (I), в якій R^2 означає етил.Перевагу надають фенілбензамідам формули (I), в якій R^1 означає трифторметил або йод.

Згідно з винаходом формула (I) охоплює такі фенілбензаміди:

N-[2-(1,3-диметилбутил)феніл]-2-(трифторметил)бензамід,

N-[2-(1,3-диметилбутил)феніл]-2-хлорбензамід,

N-[2-(1,3-диметилбутил)феніл]-2-бромбензамід,

N-[2-(1,3-диметилбутил)феніл]-2-йодбензамід,

2-(трифторметил)-N-[2-(1,3,3-триметилбутил)феніл]бензамід,

2-хлор-N-[2-(1,3,3-триметилбутил)феніл]бензамід,

2-бром-N-[2-(1,3,3-триметилбутил)феніл]бензамід,

2-йод-N-[2-(1,3,3-триметилбутил)феніл]бензамід,

[2-(трифторметил)феніл]-N-[2-(1,3,3-триметилпентил)феніл]карбоксамід,

(2-хлорфеніл)-N-[2-(1,3,3-триметилпентил)феніл]карбоксамід,

(2-бромфеніл)-N-[2-(1,3,3-триметилпентил)феніл]карбоксамід,

(2-йодфеніл)-N-[2-(1,3,3-триметилпентил)феніл]карбоксамід

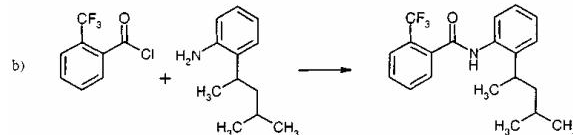
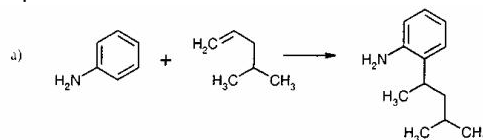
Якщо як вихідні речовини застосовують анілін

4-метил-1-пентен

та

2-

(трифторметил)бензоїлхлорид, то хід реакції запропонованого згідно з винаходом способу можна відобразити такою схемою:



Анілін, а також алкени формули (II), а саме 4-метил-1-пентен, 4,4-диметил-1-пентен та 4,4-диметил-1-гексен, які як вихідні речовини застосовують на першій стадії способу згідно з винаходом, є відомими синтетичними хімікатами, наявними у продажу.

Бензоїлхлориди формули (IV), а саме 2-(трифторметил)бензоїлхлорид, 2-хлорбензоїлхлорид, 2-бромбензоїлхлорид та 2-йодбензоїлхлорид, які як вихідні речовини застосовують на другій стадії способу згідно з винаходом, є відомими синтетичними хімікатами, наявними у продажу.

Похідні алкілфеніламіну формули (III), які одержують на першій стадії (а) способу згідно з винаходом, є новими, вони також є об'єктом даного винаходу.

Похідними алкілфеніламіну формули (III) згідно з винаходом є 2-(1,3-диметилбутил)феніламін, 2-(1,3,3-триметилбутил)феніламін та 2-(1,3,3-триметилпентил)-феніламін.

Як основи на першій стадії (а) способу згідно з винаходом застосовують всі звичайні для таких реакцій неорганічні та органічні основи Перевагу надають гранульованому алюмінію [див DE-OS 27 30 620].

Як кислоти Льюїса на першій стадії (а) способу згідно з винаходом застосовують всі звичайні для таких реакцій сполуки Перевагу надають хлориду алюмінію або хлориду заліза, особливу перевагу - хлориду алюмінію [див DE-OS 27 30 620].

Як агенти, що зв'язують кислоту, на другій стадії (b) способу згідно з винаходом застосовують всі звичайні для таких реакцій неорганічні та органічні основи. Перевагу надають гідроксидам лужноземельних або лужних металів, таким як гідроксид натрію, кальцію калію або гідроксид амонію, карбонатам лужних металів, таким як карбонат натрію, карбонат калію, гідроксид калію, гідроксид натрію, ацетатам лужних або лужноземельних металів, таким як ацетат натрію, ацетат калію, ацетат кальцію а також третинним амінам, таким як триметиламін, триетиламін, трибутиламін, N,N-диметиланілін, піридин, N-метилпіридин, N,N-диметиламінопіридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклононен (DBN) або діазабіциклоундецен (DBU). Особливу перевагу надають карбонату калію.

Як розріджувачі на другій стадії (b) способу згідно з винаходом застосовують всі звичайні інертні органічні розчинники. Перевагу надають, в разі

необхідності, галогенованим аліфатичним, аліциклическим або ароматичним вуглеводням, таким як петролейний етер, гексан, гептан циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол або декалін, хлорбензол дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ, тетрахлорметан, дихлоретан або трихлоретан, етери, такі як діетиловий етер, дмзопропіловий етер, метил-т-бутиловий етер, метил-т-аміловий етер, діоксан, тетрагидрофуран, 1,2-диметоксиетан, 1,2-діетоксиетан або анізол, нітрили, такі як ацетонітрил, пропюнітрил, н- або і-бутиронітрил або бензонітрил, амід, таю як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метилформанілід, N-метилпіролідон або три амід гексаметилфосфорної кислоти естери такі як метиловий естер оцтової кислоти або етиловий естер оцтової кислоти, сульфоксиди, такі як диметилсульфоксид, або сульфони, такі як сульфолан. Особливу перевагу надають ацетонітрилу.

При здійсненні першої стадії (а) способу згідно з винаходом реакційні температури можна варіювати у широкому діапазоні. Загалом працюють при температурах від 100°C до 300°C, переважно від 150°C до 280°C, особливо переважно від 200°C до 260°C.

При здійсненні способу згідно з винаходом загалом працюють при підвищеному тиску від 1бар до 250бар, переважно при підвищеному тиску від 50бар до 150бар.

При здійсненні другої стадії (b) способу згідно з винаходом реакційні температури можна варіювати у широкому діапазоні. Загалом працюють при температурах від -20°C до 180°C, переважно від 10°C до 50°C.

При здійсненні другої стадії (b) способу згідно з винаходом загалом працюють при атмосферному тиску. Хоча можливо також працювати при підвищеному або пониженому тиску.

При здійсненні першої стадії (а) способу згідно з винаходом на 1моль аніліну загалом застосовують від 1 до 10моль, переважно від 1,5 до 5моль, особливо переважно від 2 до 2,5моль 4-метил-1-пентену. Хоча реакційні компоненти можна також застосовувати в інших співвідношеннях. Взаємодію здійснюють звичайними методами. Загалом діють таким чином реакційну суміш перемішують з толуолом, з водною основою, органічну фазу відокремлюють та після сушіння при пониженому тиску концентрують. Осад, що залишився в разі необхідності, очищують від можливих забруднень звичайними методами, наприклад, хроматографією, дистилуванням або кристалізацією.

При здійсненні другої стадії (b) способу згідно з винаходом на 1моль бензоілхлориду формули (III) загалом застосовують 1моль або надлишкову кількість 2-(1,3-диметилбутил)феніламіну формули (II). Хоча реакційні компоненти можна також застосовувати в інших співвідношеннях. Взаємодію здійснюють звичайними методами. Загалом діють таким чином у реакційну суміш додають воду та екстрагують, органічну фазу відокремлюють, сушать та концентрують при пониженому тиску. Осад, що залишився, в разі необхідності, очищують від можливих забруднень звичайними методами, наприклад, хроматографією або кристалізацією.

Речовини згідно з винаходом проявляють високу мікробіцидну активність та можуть бути застосовані для боротьби з небажаними мікроорганізмами, такими як гриби та бактерії, у захисті рослин та матеріалів.

Фунгіциди можуть бути застосовані у захисті рослин для боротьби з *Plasmodiophoromycetes*, *Oomycetes*, *Chytridiomycetes*, *Zygomycetes*, *Ascomycetes*, *Basidiomycetes* та *Deuteromycetes*.

Бактерициди можуть бути застосовані у захисті рослин для боротьби з *Pseudomonadaceae*, *Rhizobiaceae*, *Enterobacteriaceae*, *Corynebacteriaceae* та *Streptomyetaceae*.

Нижче наведені приклади деяких збудників грибкових та бактеріальних захворювань, які належать до перерахованих вище родів та в жодному разі не обмежують обсягу охорони винаходу:

види *Xanthomonas*, наприклад, *Xanthomonas campestris pv oryzae*,

види *Pseudomonas*, наприклад, *Pseudomonas syringae pv lachrymans*,

види *Erwinia*, наприклад, *Erwinia amylovora*,

види *Pythium* наприклад, *Pythium ultimum*,

види *Phytophthora*, наприклад, *Phytophthora infestans*,

види *Pseudoperonospora* наприклад, *Pseudoperonospora humuli* або *Pseudoperonospora cubensis*,

види *Plasmopara*, наприклад, *Plasmopara viticola*,

види *Bremia*, наприклад *Bremia lactucae*

види *Peronospora*, наприклад, *Peronospora pisi* або *P brassicae*,

види *Erysiphe*, наприклад, *Erysiphe graminis*,

види *Sphaerotheca*, наприклад, *Sphaerotheca fuliginea*;

види *Podosphaera*, наприклад, *Podosphaera leucotricha*,

види *Venturia*, наприклад, *Venturia inaequalis*,

види *Pyrenophora*, наприклад, *Pyrenophora teres* або *P graminea*

(форма конідії *Drechslera*, син.: *Helminthosporium*),

види *Cochliobolus* наприклад, *Cochliobolus sativus*

(форма конідії *Drechslera*, син.: *Helminthosporium*),

види *Uromyces*, наприклад, *Uromyces appendiculatus*,

види *Puccinia*, наприклад, *Puccinia recondita*,

види *Sclerotinia*, наприклад, *Sclerotinia sclerotiorum*,

види *Tilletia*, наприклад, *Tilletia caries*,

види *Ustilago*, наприклад, *Ustilago nuda* або *Ustilago avenae*,

види *Pellicularia*, наприклад, *Pellicularia sasakii*,

види *Puccinia*, наприклад, *Puccinia oryzae*,

види *Fusarium*, наприклад, *Fusarium culmorum*,

види *Botrytis*, наприклад, *Botrytis cinerea*,

види *Septoria*, наприклад, *Septoria nodorum*,

види *Leptosphaeria* наприклад, *Leptosphaeria nodorum*,

види *Cercospora*, наприклад, *Cercospora canescens*,

види *Alternaria*, наприклад *Alternaria brassicae*,

види *Pseudocercospora*, наприклад, *Pseudo-*

cercospora herpotrichoides.

Активні речовини згідно з винаходом проявляють також сильний зміцнювальний вплив на рослини. Тому вони є придатними для мобілізації захисних сил рослин, спрямованих проти враження небажаними мікроорганізмами.

В даному контексті під речовинами, що зміцнюють рослини (індукують резистентність) слід розуміти такі речовини, які здатні настільки стимулювати захисну систему рослин, щоб оброблені рослини при подальшому зараженні небажаними мікроорганізмами проявляли високу резистентність по відношенню до цих мікроорганізмів.

Під небажаними мікроорганізмами в даному випадку слід розуміти фітопатогенні грибки, бактерії та віруси. Отже, речовини згідно з винаходом можуть бути застосовані для захисту рослин від враження вказаними збудниками хвороб протягом певного проміжку часу після обробки. Час, протягом якого діє даний захист, становить загалом від 1 до 10 переважно 1-7 днів після обробки рослин активними речовинами.

Висока сумісність рослин з активними речовинами при їх використанні в концентраціях, необхідних для боротьби із хворобами, дозволяє обробляти пригрунтові частини рослин, посадковий матеріал, насіння та ґрунт.

Активні речовини згідно з винаходом придатні також для підвищення продуктивності врожаю. Крім того вони є менш токсичними та проявляють високу сумісність з рослинами.

Активні речовини згідно з винаходом в разі необхідності, в певних концентраціях та витратних кількостях, можуть бути застосовані також як гербіциди, для впливу на ріст рослин, а також для боротьби з тваринними шкідниками. Вони, в разі необхідності, можуть також бути застосовані як проміжні та попередні продукти для синтезу інших активних речовин.

Згідно з винаходом можуть бути оброблені всі рослини та частини рослин. Під рослинами при цьому розуміють всі рослини та популяції рослин, такі як бажані та небажані дикоростучі рослини або культурні рослини (включаючи культурні рослини природного походження) Культурними рослинами можуть бути рослини, які можна одержати звичайними методами культивування та оптимізації або біотехнологічними та генно-інженерними методами або комбінаціями цих методів, включаючи трансгенні рослини та сорти рослин, що захищаються або не захищаються законом про охорону нових сортів рослин. Під частинами рослин слід розуміти всі надземні та підземні частини та органи рослин, як парость, лист, квітка та корінь, при цьому слід назвати також, наприклад, листи, голки, стебла, стовбури, квіти, плодові тіла, плоди та насіння, а також корені, бульби та ризоми. До частин рослин належать також зібраний врожай та вегетативний і генеративний матеріал для розмноження, наприклад, черешки, бульби, ризоми, відводки та насіння.

Згідно з винаходом обробку рослин та частин рослин активними речовинами здійснюють безпосередньо або шляхом впливу на їх оточення, середовище їх росту або закриті сховища відповідно до звичайних методів обробки, наприклад, шляхом

занурення, мілкокрапельного обприскування, випару, створення штучного туману, розкидання, намазування, а у випадку матеріалу для розмноження, особливо у випадку насіння, шляхом одношарового або багатшарового покриття.

У захисті матеріалів речовини згідно з винаходом застосовують для захисту технічних матеріалів від ураження та руйнування небажаними мікроорганізмами.

Під технічними матеріалами у даному контексті слід розуміти матеріали, виготовлені для застосування у техніці. Прикладами таких технічних матеріалів, які повинні бути захищені активними речовинами згідно з винаходом від зміни або руйнування мікроорганізмами, є клейкі речовини, глини, папір та картон, тканини, шкіра, деревина, лакофарбові матеріали та вироби з пластмаси, змазки та інші матеріали, які можуть бути уражені або зруйновані мікроорганізмами. В рамках матеріалів, що підлягають захисту, слід також назвати частини виробничого устаткування, наприклад, замкнені цикли охолодження, які можуть бути пошкоджені внаслідок розмноження мікроорганізмів. В рамках даного винаходу як технічним матеріалам перевагу надають клейким речовинам, глинам, паперу та картону, шкірі, деревині, лакофарбовим матеріалам, змазкам та рідким теплоносіям, особливо деревині.

Серед мікроорганізмів, які можуть впливати на руйнування або зміну технічних матеріалів, слід, наприклад, назвати бактерії, грибки, дріжджі, водорості та слизові організми. Активні речовини згідно з винаходом переважно впливають на грибки, зокрема плісняву, на грибки, що псують та руйнують деревину (*Basidiomyceten*), а також на слизові організми та водорості.

Необхідно, наприклад, назвати мікроорганізми таких родів:

Alternaria такі як *Alternaria tenuis*,
Aspergillus, такі як *Aspergillus niger*,
Chaetomium, такі як *Chaetomium globosum*,
Coniophora, такі як *Coniophora puetana*,
Lentinus, такі як *Lentinus tignus*,
Penicillium, такі як *Penicillium glaucum*,
Polyporus, такі як *Polyporus versicolor*,
Aureobasidium, такі як *Aureobasidium pullulans*,
Sclerophoma, такі як *Sclerophoma pityophila*,
Tnchodema, такі як *Tnchodema viride*,
Eschenchia, такі як *Eschenchia coli*,
Pseudomonas, такі як *Pseudomonas aeruginosa*,

Staphylococcus, такі як *Staphylococcus aureus*.

Активні речовини згідно з винаходом в залежності від їх відповідних фізичних та/або хімічних властивостей можуть бути перетворені на звичайні препаративні форми, такі як розчини, емульсії, суспензії, порошки, піни, пасти, грануляти аерозолі, мікрокапсульовані в полімерні речовини для насіння, а також УФ-композиції з утворенням туману холодним та гарячим способом.

Ці композиції одержують відомими способами, наприклад, змішуванням активних речовин з розріджувачами, тобто рідкими розчинниками, розрідженими газами під тиском та/або твердими носіями, в разі необхідності, при застосуванні поверхнево-активних речовин, тобто емульгаторів

та/або диспергаторів та/або піноутворюючих речовин. У випадку використання води як розріджувача можуть також бути застосовані, наприклад, органічні розчинники як допоміжні засоби, що поліпшують розчинення. Як рідкі органічні розчинники в основному застосовують ароматичні сполуки, такі як ксилол, толуол, або алкілнафталіни хлоровані ароматичні сполуки або хлоровані аліфатичні вуглеводні, такі як хлорбензоли, хлоретилени або метиленхлорид, аліфатичні вуглеводні, такі як циклогексан або парафіни, наприклад, фракції нафти, 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. Під розрідженими газоподібними розріджувачами або носіями розуміють такі рідини, які при нормальній температурі та нормальному тиску існують у формі газу, наприклад, газу аерозолі, такі як галогенвуглеводні, а також бутан, пропан, азот та діоксид вуглецю. Як тверді носи мають на увазі наприклад, помели природних каменів, таких як каоліни, глиноземи, тальк, крейда, кварц, атапульгіт, монтморилоніт або діатомова земля, та помели синтетичних каменів такі як високодисперсна кремнієва кислота, оксид алюмінію та силікати. Як тверді носи для гранулятів мають на увазі наприклад, подрібнені та фракціоновані природні кам'яні породи, такі як кальцит, мармур, пемза, сепіоліт, доломіт, синтетичні грануляти з неорганічного або органічного борошна, а також грануляти з органічного матеріалу, такого як тирса, шкарлупа кокосових горіхів, кукурудзяні качани та стебла тютюну. Як емульгатори та/або піноутворюючі засоби мають на увазі наприклад, неіоногенні та аніонні емульгатори, такі як поліоксиетиленовий естер жирної кислоти, поліоксиетиленовий етер жирного спирту, наприклад, алкіларилполігліколевий етер, алкілсульфонати, алкілсульфати, арилсульфонати, а також гідролізати білку. Як диспергуючі засоби мають на увазі наприклад, відпрацьовані лігнінсульфітні луки та метилцеллюлозу.

У композиціях можуть бути застосовані речовини, що поліпшують адгезію, такі як карбоксиметилцеллюлоза, природні та синтетичні порошкоподібні, зернисті або латексоподібні полімери, такі як гуміарабік, полівініловий спирт, полівінілацетат, а також природні фосфоліпіди, такі як кефаліни та лецитини, та синтетичні фосфоліпіди. Іншими добавками можуть бути мінеральні масла та рослинні олії.

Можуть бути застосовані барвники, такі як неорганічні пігменти, наприклад, оксид заліза, оксид титану, фероціан синій, та органічні барвники, такі як алізарин-, азо- та металфталоціанінові барвники та слідові кількості живильних мікроелементів, таю як солі заліза, марганцю, бору, міді, кобальту, молібдену та цинку.

Композиції містять загалом від 0,1 до 95ваг.% активної речовини, переважно, від 0,5 до 90ваг.% активної речовини.

Активні речовини згідно з винаходом можуть бути використані як такі або у своїй препаративній формі змішані з відомими фунгіцидами, бактерицидами, акарицидами, нематоцидами або інсекти-

цидами з метою розширення спектру дії або запобігання розвитку резистентності. У багатьох випадках при цьому одержують синергічні ефекти, тобто ефективність суміші є вищою ніж ефективність м окремих компонентів.

Для змішування використовують, наприклад, такі сполуки:

Фунгіциди:

2-фенілфенол; 8-гідроксихінолінсульфат;

ацибензолар-S-метил; алдиморф; амідифлумет; ампропілфос; ампропілфос-калій; андоприм; анілазин; азаконазол; азоксистробін;

беналаксил; беноданіл; беноміл; бентіавалікарб-ізопропіл; бензамакрил; бензамакрил-ізобутил біланафос; бінапакрил; біфеніл; бітертанол; бластицидин-S; бромуконазол; бупіримат; бутіобат; бутила мін;

полісульфід кальцію; капсиміцин; каптафол; каптан карбендазин; карбоксин; карпропамід; карвон; хінометіонат; хлобензтіазон; хлорфеназол; хлоронеб; хлороталоніл; хлосолінат; хлосилакон; ціазофамід; цифлуфенамід; цимоксаніл; ципроконазол; ципродиніл; ципрофурам;

драже G; дебакарб; дихлофуанід; дихлон; дихлорофен; диклоцимет; дикломецин диклоран; діетофенкарб дифеноконазол; дифлуметорим; диметиримол; диметоморф; димоксистробін; диніконазол диніконазол-M; динокап; дифеніламін; дипіритіон; диталімфос; дитіанон; додин; дразоксолон;

едифенфос; епоксиконазол; етабоксам; етиримол; етридіазол;

фамоксадон; фенамідон; фенапаніл; фенаримол; фенбуконазол; фенфурам; фенгексамід; фенітропан; феноксаніл; фенпиклоніл; фенпропідин; фенпропіморф; фербам; флуазинам; флубензімін флудіоксоніл; флуметовер; флуморф; фтормід; іфлуоксастробін; флуквіконазол; флурпримідол; флузилазол; флусульфамід; флутоланіл; флутриафол; фолпет; фозетил-алюміній; фозетил-натрій; фуберидазол; фуралаксил; фураметпір; фуркарбаніл; фуемециклокс;

гуазатин; гексахлорбензен; гексаконазол; пмексказол;

імазаліл імібенконазол; іміноктадинтриацетат; іміноктадинтрис(альбесил) йодокарб; іпконазол; іпробенфос; іпродіон; іпровалкарб; ірумамідин; ізопротюлан ізоваледіон;

казугаміцин; крезоксим-метил;

манкозеп; манеб; меферимзон; мепаніпірим; мепроніл; металаксил; металаксил-M; метконазол; метасульфокарб; метфуроксам; метирам; метоміностробін; метсульфовакс; мілдіюміцин; миклобутаніл; миклозолін;

натаміцин; нікобіфен; нітротал-ізопропіл; новіфлумурон; нуаримол;

офурак; оризастробін; оксаксидил; оксолінова кислота; окспоконазол; оксикарбоксин; оксифентіін;

паклобутразол; пефуразоат; пенконазол; пенцикурон; фосдифен; фталід; пікоксистробін; піпералін; поліоксин; поліоксорим; пробеназол; прохлораз; процимідон; пропамоккарб; пропанозин-натрій; пропіконазол; пропінеб; прохіназид; протіокконазол; піраклостробін; піразофос пірифенокс піриметаніл; пірохлон піроксифур піролнітрин;

хінконазол хінксофен; хінтозен;
симеконазол спіроксамін; сульфур;
тебуконазол теклофталам; текназен; тетцикла-
цис; тетраконазол; тіабендазол; тиціофен; тиф-
лузамід; тофанат-метил; тирам; тіоксимід; толк-
лофос-метил; толілфлуанід; триадимефон;
триадименол; триазбутил; триазоксид; трицикла-
мід; трициклазол; тридеморф; трифлуксистеробін;
трифлумізол трифорин; тритиконазол;
уніконазол валідамідин А; вінклозолін; зинеб;
зирам; зоксамід;
(2S)-N-[2-[4-[[3-(4-хлорфеніл)-2-пропіл]окси]-3-
метоксифеніл]етил]-3-метил-2-
[(метилсульфоніл)аміно]бутанамід,
1-(1-нафталеніл)-1Н-пірол-2,5-діон,
2,3,5,6-тетрахлор-4-(метилсульфоніл)піридин,
2-аміно-4-метил-N-феніл-5-тіазолкарбоксамід,
2-хлор-N-(2,3-дипро-1,1,3-триметил-1Н-інден-
4-іл)-3-піридинкарбоксамід,
3,4,5-трихлор-2,6-піридиндикарбонітрил, акти-
новат,
цис-1-(4-хлорфеніл)-2-(1Н-1,2,4-тіазол-1-
іл)циклогептанол,
метил 1-(2,3-дипро-2,2-диметил-1Н-інден-1-
іл)-1Н-імідазол-5-карбоксилат,
карбонат монокалію,
N-(6-метокси-3-
піридин)циклопропанкарбоксамід,
N-бутил-8-(1,1-диметилетил)-1-
оксапіро[4.5]декан-3-амін,
тетратіокарбонат натрію,
а також солі міді та композиції з міді, такі як
бордоска суміш, гідроксид міді, нафтенат міді ок-
сихлорид міді, сульфат міді, куфранеб, оксид міді,
мономідь, оксин-мідь.
Бактерициди:
бронопол, дихлорофен, нітрапірин, нікель-
диметилдитіокарбамат, касугаміцин, октилінон,
фуранкарбонова кислота, окситетрациклін, пробе-
назол, стрептомицин, теклофталам, сульфат міді
та інші сполуки, що містять мідь.
Інсектициди/Акарициди/Нематоциди:
абамектин ацефат, ацетаміприд, акринатрин,
аланікарб, алдікарб, алдоксикарб, альфа-
циперметрин альфаметрин, амітраз, авермектин,
AZ-60541, азадирахтин, азаметинос, азиннос А,
азиннос М, азоциклотин,
Bacillus popilliae, *Bacillus sphaencus*, *Bacillus*
subtilis, *Bacillus thuringiensis*, *Baculo* віруси *Beau-*
vena bassiana, *Beauvena tenella*, бендюкарб, бен-
фуракарб, бенсультап, бензоксимат, бетацифлут-
рин, біфеназат, біфентрин, бюетанометрин,
бюперметрин бістрифлурон, ВРМС, бромонос А,
буфенкарб, бупрофецин, бутатіонос, бутокарбок-
сим, бутілпіридабен,
кадусанос, карбарил, карбофуран, карбофе-
нотіон, карбосульфат, картап, хлоетокарб, хлоре-
токсифос, хлорфенапір, хлорфенвінос, хло флау-
зурон, хлорменос, хлорпіринос, хлорпіринос М,
хлопаортрин, хромафенозид, цис-резметрин,
цис-перметрин, клоцитрин, клоетокарб, клофенте-
зин, клотіанідин, ціанонос, циклопрен, циклопрот-
рин, цифлутрин, цигалотрин, цигексатин, ципер-
метрин, циромазин,
дельтаметрин, деметон М, деметон-3-метил,
діафентіурон, діазинон, дихлорвос, дикофол, ди-

флубензурон, диметоат, диметилвінос, дюфено-
лан, дисульфотон, докузат-натрій, дофенапір,
ефлузиланат, емаектин, емпентрин, ендосу-
льфан, *Entomorphthora* spp., есфенвалерат, етіо-
фенкарб, етіон, етіпронос, етіфенпрокс, етокса-
зол, етримнос,
фенамінос феназаквін, фенбутатин оксид,
фенітротіон фенотіокарб, феноксакрим, фенокси-
карб, фенпропатрин, фенпірад, фенпіритрин, фе-
ніпроксимат, фенвалерат, фіпроніл, флазурон,
флуроцитринат, флуциклоксурон, флуцитринат,
флуфеноксурон флуметрин, флутензин, флувалі-
нат, фоновос, фосметилан, фостіазат, фубфен-
прокс, фураціокарб, гранулоподібі віруси,
галофенозид, НСН, гептенонос, гексафлум у-
рон, гекситазіокс, гідропрен,
імідаклопрід, індоксикарб, ізазос, ізофен-
нос, ізоксатіон, івермектин,
віруси поліедроза, ламбда-цигалотрин, луфе-
нурон,
малатіон, мекарбам, металдепд, метамідо-
нос, *Metharhizium anisopliae*, *Metharhizium*
flavoviride, метидатіон, метіокарб, метопрен, мето-
міл, метоксифенозид, метолкарб, метоксидіазон,
мевіннос, мілбемектин, мілбемідин, монокрото-
нос,
налед, нітенпірам, нітіазин, новалурон, омето-
ат, оксаміл, оксидеметон М,
Paecilomyces fumosoroseus, паратіон А, пара-
тіон М, перметрин, фентоат, форат, фозалон, фо-
змет, фосфамідон, фоксим, піримікарб, піримінос
А, піримінос М, профенос, промеккарб, про-
парл, пропосур, протіонос, протоат, піметрозин,
піраклос, пірезметрин піретрум, піридабен, пі-
ридатіон, піримідифен пірипроксифен,
хіналнос, рибавірин,
салітіон, себунос, силафлуофен, спіносад,
спіродиклофен, сульфотеп, сульпронос,
тау-флувалінат, тебуфенозид, тебуфенпірад,
тебупіримінос, тефлубензурон, тефлутрин, тем-
нос, темівіннос, тербунос, тетрахлорвінос, тет-
радіфон, тета-циперметрин, тіаклопрід, тіаметок-
сам, тіапроніл, тіатринос, тіоциклам гідрооксалат,
тіодикарб, тіофанокс турнінгенсин, тралоцитрин,
тралометрин, триаратен, триазамат, триазос, три-
азурон, трихлорфенідин, трихлорфон, трифлу-
мурон, три мета карб,
вамідатіон, ваніліпрол, *Verticillium lecanii*,
YI-5302 зета-циперметрин, золапронос,
(1R-цис)-[5-(фенілметил)-3-фураніл]метил-3-
[(дигідро-2-оксо-3(2H)-фураніліден)-метил]-2,2-
диметилциклопропанкарбоксилат,
(3-феноксифеніл)-метил-2,2,3,3-
тетраметилциклопропанкарбоксилат,
1-[(2-хлор-5-тіазоліл)метил]тетрапро-3,5-
диметил-N-нітро-1,3,5-триазин-2(1H)-імін,
2-(2-хлор-6-фторфеніл)-4-[4-(1,1-
диметилетил)феніл]-4,5-дигідрооксазол,
2-(ацетилоси)-3-додещил-1,4-нафталіндіон,
2-хлор-N-[[[4-(1-
фенілетокси)феніл]аміно]карбоніл]бензамід,
2-хлор-N-[[[4-(2,2-дихлор-1,1-
дифторетокси)феніл]аміно]карбоніл]бензамід,
3-метилфенілпропілкарбамат,
4-[4-(4-етоксифеніл)-4-метилпентил]-1-фтор-2-
феноксифеніл,

4-хлор-2-(1,1-диметилетил)-5-[[2-(2,6-диметил-4-феноксифенокс)етил]тію]-3(2H)-піридазинон,
 4-хлор-2-(2-хлор-2-метилпропіл)-5-[(6-йод-3-піридиніл)метокси]-3(2H)-піридазинон,
 4-хлор-5-[(6-хлор-3-піридиніл)метокси]-2-(3,4-дихлорфеніл)-3(2H)-піридазинон,
Bacillus thuringiensis лінія EG-2348,
 [2-бензоіл-1-(1,1-Диметилетил)гідразид бензоїної кислоти,
 2,2-диметил-3-(2,4-дихлорфеніл)-2-оксо-1-оксастіро[4.5]дец-3-ен-4-іл-ефір бутанової кислоти
 [3-[(6-хлор-3-піридиніл)метил]-2-тіазолідиніліден]ціанамід,
 дигідро-2-(нітрометилен)-2H-1,3-триазин-3(4H)-карбоксальдегід,
 етил-[2-[[1,6-дигідро-6-оксо-1-(фенілметил)-4-піридазиніл]окси]етил]карбамат,
 N-(3,4,4-трифтор-1-оксо-3-бутеніл)гліцин,
 N-(4-хлорфеніл)-3-[4-(диформетокси)феніл]-4,5-дигідро-4-феніл-1H-піразол-1-карбоксамід,
 N-[(2-хлор-5-тіазоліл)метил]-N'-метил-N"-нітрогуанідин,
 N-метил-N'-(1-метил-2-пропеніл)-1,2-пдразиндикарботоамід,
 N-метил-N'-2-пропеніл-1,2-гідразиндикарботоамід,
 О,О-діетил-[2-(дипропіламіно)-2-оксоетил]етилфосфорамідотіоат,
 N-ціанометил-4-трифторметилнікотинамід,
 3,5-дихлор-1-(3,3-дихлор-2-пропенілокси)-4-[3-(5-трифторметилпіридин-2-ілокси)-пропокси]бензол.

Можливою є також суміш з іншими відомими активними речовинами такими як гербіциди, або з добривами та регуляторами росту рослин.

Крім того сполуки формули (I) згідно з винаходом також проявляють сильну протигрибкову активність. У них досить широкий спектр протигрибкової дії, сюди зокрема належать дерматофіти та грибки, пліснява та двофазові грибки (наприклад, вид *Candida*, як наприклад *Candida albicans*, *Candida glabrata*), а також *Epidemophyton floccosum*, вид *Aspergillus* як наприклад, *Aspergillus niger* та *Aspergillus fumigatus*, вид *Trichophyton*, як, наприклад, *Trichophyton mentagrophytes*, вид *Microsporon*, як, наприклад, *Microsporon canis* та *audouinii*. Перелік цих грибів в жодному разі не обмежує спектр дії, він має лише пояснювальний характер.

Активні речовини можуть бути застосовані як такі, у вигляді їх препаративних форм або у вигляді одержаних з них форм, готових до застосування, таких як розчини, суспензії, порошки, що змочуються, паста, розчинні порошки, дуети та грануляти. Застосування відбувається звичайними способами, наприклад, шляхом лиття, розбрикування, розпилення, розкидання, запилення, обробки піною, намазування і т.д. Крім того можливим є також нанесення активних речовин способом Ultra-Low-Volume (наднизького об'єму) або шляхом впрорскування композиції активних речовин або самої активної речовини в ґрунт. Можливо також обробляти насіння рослин перед посівом.

При застосуванні активних речовин згідно з винаходом як фунгіцидів витратні кількості в залежності від виду нанесення можна варіювати в ши-

рокому діапазоні. При обробці частин рослин витратна кількість активної речовини загалом становить від 0,1 до 10 000г/га, переважно від 10 до 1000г/га. При обробці насіння витратна кількість активної речовини загалом становить від 0 001 до 50г на кілограм насіння, переважно від 0,01 до 10г на кілограм насіння. При обробці фунту витратна кількість активної речовини загалом становить від 0,1 до 10 000г/га переважно від 1 до 5000г/га.

Як було вже зазначене вище, згідно з винаходом можна обробляти всі рослини та їх частини. У переважному варіанті виконання винаходу обробляють види та сорти рослин, а також їх частини, вирощені або одержані за умов біологічного розведення, наприклад, схрещування або злиття протопластів. В іншому переважному варіанті виконання обробляють трансгенні рослини та сорти рослин, одержані гентехнологічними методами, в разі необхідності, у комбінації зі звичайними методами (генетично модифіковані організми) та їх частини. Поняття «частини» або «частини рослин» або «органі рослин» були роз'яснені вище.

Найбільш переважно згідно з винаходом обробляють наявні у продажу або у використанні сорти рослин. Під сортами рослин розуміють рослини з визначеними властивостями (ознаками), які одержують звичайними методами розведення, мутагенезом або рекомбінантними методиками ДНК. Це можуть бути сорти, види, біотики та генотипи.

В залежності від виду або сорту рослин, їх походження та умов росту (ґрунт, клімат період вегетації, харчування) в результаті обробки згідно з винаходом можуть спостерігатися нададитивні («синергічні») ефекти. Так, наприклад, можливе зниження кількості застосовуваних речовин та/або розширення спектру дії та/або посилення дії речовин та засобів згідно з винаходом, покращення росту рослин, підвищена толерантність по відношенню до високих або низьких температур, підвищена толерантність до браку вологості або до вмісту солей у воді або у ґрунті, підвищена продуктивність при цвітінні, полегшення збору врожаю, прискорення дозрівання, більш високий врожай, більш висока якість та/або більш висока поживність продуктів врожаю, краще збереження та/або краща здатність до переробки продуктів врожаю, що виходять за межі власне очікуваних ефектів.

До переважних трансгенних (отриманих з використанням генних технологій) рослин або сортів рослин згідно з винаходом належать всі рослини, містять генетичний матеріал, модифікований за генною технологією, що додає цим рослинам особливо вигідних цінних властивостей. Прикладами таких властивостей є кращий ріст рослин, підвищена толерантність по відношенню до високих або низьких температур, підвищена толерантність до браку вологості або до вмісту солей у воді або у ґрунті, підвищена продуктивність при цвітінні, полегшення збору врожаю, прискорення дозрівання, більш високий врожай, більш висока якість та/або більш висока поживність продуктів врожаю, більша тривалість збереження та/або краща здатність до переробки продуктів врожаю. До інших та особливо переважних прикладів таких властивостей належать підвищена стійкість рослин до тваринних

шкідників та до мікроорганізмів, таких як комахи, кліщі, патогенні для рослин грибки, бактерії та/або віруси, а також підвищена толерантність рослин до певних гербіцидних активних речовин. Як приклади трансгенних рослин слід згадати важливі культурні рослини, такі як зернові (пшениця, рис), кукурудза, соя, картопля, бавовна, рапс, а також фруктові рослини (із плодами яблук, груш, плодами цитрусових та виноград), причому особливу перевагу надають кукурудзі, сої, картоплі, бавовні та рапсу. До особливо переважних властивостей належать підвищена стійкість рослин до комах у зв'язку з токсинами, особливо такими, які утворюються за допомогою генетичного матеріалу з *Bacillus Thuringiensis* (наприклад, за допомогою генів CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIA, CryIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb та CryIF а також їх комбінацій) у рослинах (надалі "Бт. рослини"). До особливо переважних властивостей належать також підвищена стійкість рослин по відношенню до грибів, бактерій та вірусів завдяки набутій системній стійкості (SAR), системіну, фітоалексину, еліциторам, а також генам резистентності та протеїнам і токсинам. Крім того до особливо переважних властивостей належать також підвищена толерантність рослин по відношенню до певних гербіцидно активних речовин наприклад, імідазолінонів, сульфонілкарбамідів, гліфозатів або фосфінотрицину (наприклад, "PAT"-ген). Гени, що забезпечують бажані властивості, у комбінаціях між собою можуть зустрічатися в трансгенних рослинах. Прикладами "Бт. рослин" є сорти кукурудзи, бавовни, сої та картоплі, наявні у продажу під торговельними марками YIELD GARD® (наприклад, кукурудза, бавовна, соя), KnockOut® (наприклад, кукурудза), StarLink® (наприклад, кукурудза), Bollgard® (бавовна), Nucoton® (бавовна) та NewLeaf® (картопля). Прикладами толерантних до гербіцидів рослин є сорти кукурудзи, бавовни та сої, наявні у продажу під торговельними марками Roundup Ready® (толерантність по відношенню до гліфозату, наприклад, кукурудза, бавовна, соя), Liberty Link® (толерантність по відношенню до фосфінотрицину, наприклад, рапс), IMI® (толерантність по відношенню до імідазолінонів) та STS® (толерантність по відношенню до сульфонілкарбамідів, кукурудза). Стейкими до гербіцидів (звичайно вирощені в умовах толерантності по відношенню до гербіцидів) рослинами є наявні у продажу під назвою Clearfield® сорти рослин (наприклад, кукурудза). Зрозуміло, що ці висловлення справедливі і для сортів рослин що будуть створені в майбутньому або які в майбутньому потраплять на ринок з цими або в майбутньому створеними генетичними властивостями.

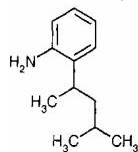
Найбільш переважно згідно з винаходом зазначені рослини можуть бути оброблені сполуками формули (I) або сумішами активних речовин згідно з винаходом. Вказані вище області переважних значень активних речовин або сумішей також використовують для обробки таких рослин. Найбільш переважно обробку рослин проводять спеціально зазначеними в даному тексті сполуками або сумішами.

Одержання та застосування активних речовин згідно з винаходом демонструють наведені нижче

прикладі.

Приклади одержання

Приклад 1: одержання 2-(1,3-диметилбутил)феніламіну формули

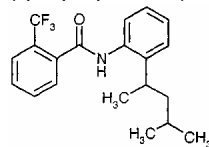


Суміш із 62,8г (0,67моль) аніліну, 132,8г (1,58моль) 4-метилпент-1-ену, 1,82г гранульованого алюмінію та 5,58г (41,8ммоль) хлориду алюмінію нагрівають у сталевому автоклаві до 255°C. Реакційну суміш протягом 10 годин залишають при власному тиску та тій самій температурі.

Після охолодження та зниження тиску для переробки вміст автоклаву разом з відповідною кількістю толуолу поміщають у новий резервуар та при 30-40°C протягом 15 хвилин перемішують з 80мл 40%-ного натрієвого лугу та 100мл води. Органічну фазу відокремлюють, промивають водою та сушать над карбонатом калію. Після видалення толуолу на ротаційному випарнику розділений на фракції залишок дистилують.

Одержують 43,9г (33%) 2-(1,3-диметилбутил)феніламіну у вигляді безбарвного масла (температура кипіння 73-85°C, 0,3мбар).

Приклад 2: N-[2-(1,3-диметилбутил)феніл]-2-(трифторметил)бензамід

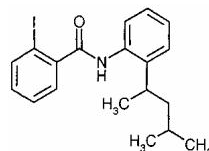


До суспензії 4,15г карбонату калію в 200мл ацетонітрилу по краплях додають 5,32г (30ммоль) 2-(1,3-диметилбутил)феніламіну (приклад 1) та 6,26г (30ммоль) 2-(трифторметил)бензоїлхлориду. Реакційну суміш перемішують протягом 10 годин.

Для переробки до реакційного розчину додають 200мл води, та суміш екстрагують етилацетатом. Органічні фази сушать над сульфатом натрію та концентрують. Залишок піддають хроматографії на силікагелі (градієнт: циклогексан 100% - суміш циклогексан/етилацетат 1:4).

Одержують 5,00г (46%) N-[2-(1,3-диметилбутил)феніл]-2-(трифторметил)бензаміду, logP (pH2,3)=4,09.

Приклад 3: N-[2-(1,3-диметилбутил)феніл]-2-йодбензамід



До суспензії 2,76г карбонату калію в 100мл ацетонітрилу по краплях додають 3,55г (20ммоль) 2-(1,3-диметилбутил)феніламіну (приклад 1) та 5,33г (20ммоль) 2-йодбензоїл-хлориду. Реакційну суміш перемішують протягом 10 годин.

Для переробки до реакційного розчину додають 100мл води, та суміш екстрагують етилацетатом. Органічні фази сушать над сульфатом натрію та концентрують. Залишок піддають хроматографії на силікагелі (градієнт: циклогексан 100% - суміш

циклогексан/етилацетат 1:4).

Одержують 7,00г (83%) N-[2-(1,3-диметилбутил)феніл]-2-йодбензаміду, $\log P(\text{pH}2,3)=4,12$.

Аналогічно наведеним вище прикладам, виходячи з аніліну та 4-метилпент-1-ену, а також 2-хлорбензоїлхлориду або 2-бромбензоїлхлориду одержують такі сполуки.

Приклад 4: N-[2-(1,3-диметилбутил)феніл]-2-хлорбензамід, $[\log P(\text{pH}2,3)=3,98]$.

Приклад 5: N-[2-(1,3-диметилбутил)феніл]-2-бромбензамід, $[\log P(\text{pH}2,3)=4,01]$.

Аналогічно наведеним вище прикладам, крім того виходячи з аніліну та 4,4-диметил-1-пентену, а також 2-(трифторметил)бензоїлхлориду, 2-хлорбензоїлхлориду, 2-бромбензоїлхлориду або 2-йодбензоїлхлориду одержують такі сполуки:

Приклад 6: 2-(трифторметил)-N-[2-(1,3,3-триметилбутил)феніл]бензамід, $[\log P(\text{pH}2,3)=4,36]$.

Приклад 7: 2-хлор-N-[2-(1,3,3-триметилбутил)феніл]бензамід, $[\log P(\text{pH}2,3)=4,25]$.

Приклад 8: 2-бром-N-[2-(1,3,3-триметилбутил)феніл]бензамід, $[\log P(\text{pH}2,3)=4,29]$.

Приклад 9: 2-йод-N-[2-(1,3,3-триметилбутил)феніл]бензамід, $[\log P(\text{pH}2,3)=4,40]$.

Приклад 10: (2-йодфеніл)-N-[2-(1,3,3-триметилпентил)феніл]карбоксамід, $[\log P(\text{pH}2,3)=4,71]$.

Приклад 11: [2-(трифторметил)феніл]-N-[2-(1,3,3-триметилпентил)феніл]карбоксамід, $[\log P(\text{pH}2,3)=4,68]$.

Приклад 12: (2-хлорфеніл)-N-[2-(1,3,3-триметилпентил)феніл]карбоксамід, $[\log P(\text{pH}2,3)=4,60]$.

Приклад 13: (2-бромфеніл)-N-[2-(1,3,3-триметилпентил)феніл]карбоксамід, $[\log P(\text{pH}2,3)=4,63]$.

Визначення вказаних у прикладах одержання значень $\log P$ відбувається згідно з інструкціями Європейської Спільноти 79/831, VA8 за допомогою HPLC (High Performance Liquid Chromatography - вискоєфективної рідинної хроматографії) на колоні інверсії фаз (C 18) Температура 43°C.

Елюенти для визначення в кислому середовищі 0,1% водного розчину фосфорної кислоти, ацетонітрил, лінійний градієнт від 10% до 90% ацетонітрилу

Калібрування відбувається за допомогою нерозгалужених алкан-2-онів (що містять 3-16 атомів вуглецю), $\log P$ -значення яких відомі (визначення $\log P$ -значень на основі часу утримування шляхом лінійної інтерполяції між двома сусідніми алканами).

Приклади застосування

Приклад А

Дослідження *Sphaerotheca* (на огірках) / захисна дія

Розчинник: 24,5ваг. частин ацетону,

24,5ваг. частин диметилацетаміду,

Емульгатор: 1,0ваг. частина алкіларилполіглі-

колевого етеру.

Для одержання необхідної композиції активних речовин 1 вагову частину активної речовини перемішують із вказаною кількістю розчинника та емульгатора, концентрат розріджують до необхідної концентрації водою.

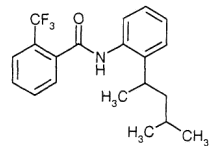
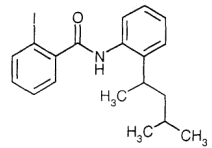
Для дослідження захисної дії молоді рослини обприскують композицією активної речовини зазначеної витратної кількості. Після висихання розчину рослини заражають водною суспензією збудника *Sphaerotheca fuliginea* та після цього поміщають у теплицю при температурі приблизно 23°C та відносній вологості повітря приблизно 70%.

Через 7 днів після зараження проводять оцінку. При цьому, 0% означає ступінь дії, що відповідає контрольним зразкам, в той час як ступінь дії 100% означає, що враження шкідниками не спостерігалось.

Активні речовини, витратні кількості та результати досліджень наведені нижче в таблиці.

Таблиця А

Дослідження *Sphaerotheca* (на огірках) / захисна дія

Активна речовина	Витратна кількість активн. речов. в г/га	Ступінь дії в %
	100	100
	100	100

22 Приклад В

Дослідження *Venturia* (на яблуках) / захисна дія

Розчинник: 24,5ваг. частин ацетону,

24,5ваг. частин диметилацетаміду

Емульгатор: 1,0ваг. частина алюларилполігліколевого етеру.

Для одержання необхідної композиції активних речовин 1 вагову частину активної речовини перемішують із вказаною кількістю розчинника та емульгатора, концентрат розріджують до необхідної концентрації водою.

Для дослідження захисної дії молоді рослини обприскують композицією активної речовини зазначеної витратної кількості. Після висихання розчину рослини заражають водною суспензією конідій збудника яблучного струпу *Venturia maequalis* та після цього на 1 день поміщають в інкубаційну камеру при температурі приблизно 20°C та відносній вологості повітря 100%.

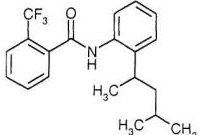
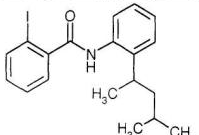
Потім рослини поміщають в теплицю при температурі приблизно 21°C та відносній вологості повітря 90%.

Через 10 днів після зараження проводять оцінку. При цьому, 0% означає ступінь дії, що відповідає контрольним зразкам, в той час як ступінь дії 100% означає, що враження шкідниками не спо-

стерігалось.

Активні речовини, витратні кількості та результати досліджень наведені нижче в таблиці.

Таблиця В
Дослідження *Venturia* (на яблуках) / захисна дія

Активна речовина	Витратна кількість активн. речов. в г/га	Ступінь дії в %
	100	100
	100	100

Приклад С

Дослідження *Botrytis* (на бобах) / захисна дія

Розчинник: 49ваг. частин N,N-диметилформаміду,

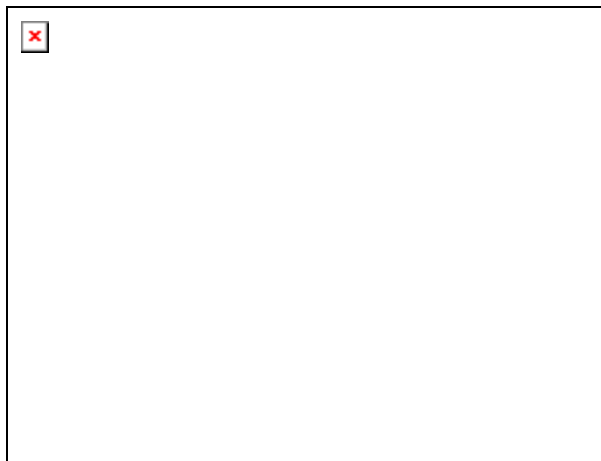
Емульгатор: 1ваг. частина аліларилполігліколевого етеру.

Для одержання необхідної композиції активних речовин 1 вагову частину активної речовини перемішують із вказаною кількістю розчинника та емульгатора, концентрат розріджують до необхідної концентрації водою.

Для дослідження захисної дії молоді рослини обприскують композицією активної речовини зазначеної витратної кількості. Після висихання розчину на кожен лист кладуть 2 маленькі шматочки агару, заражені *Botrytis cinerea*. Заражені рослини поміщають в інкубаційну камеру при температурі приблизно 20°C та відносній вологості повітря 100%.

Через 2 дні після зараження оцінюють розмір плям на листках. При цьому, 0% означає ступінь дії, що відповідає контрольним зразкам, в той час як ступінь дії 100% означає, що враження шкідниками не спостерігалось.

Активні речовини витратні кількості та результати досліджень наведені нижче в таблиці.



Приклад D

Дослідження *Alternaria* (на томатах) / захисна дія

Розчинник: 49ваг. частин N,N-диметилформаміду,

Емульгатор: 1ваг. частина аліларилполігліколевого етеру.

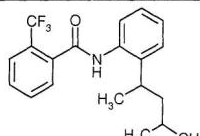
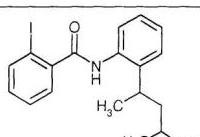
Для одержання необхідної композиції активних речовин 1 вагову частину активної речовини перемішують із вказаною кількістю розчинника та емульгатора концентрат розріджують до необхідної концентрації водою.

Для дослідження захисної дії молоді рослини томату обприскують композицією активної речовини зазначеної витратної кількості. Через 1 день після обробки рослини заражають водною суспензією спор *Alternaria solani* та залишають протягом 24 годин при відносній вологості 100%. Після цього рослини при відносній вологості приблизно 96% залишають при температурі 20°C.

Через 7 днів після зараження проводять оцінку. При цьому, 0% означає ступінь дії, що відповідає контрольним зразкам, в той час як ступінь дії 100% означає, що враження шкідниками не спостерігалось.

Активні речовини, витратні кількості та результати досліджень наведені нижче в таблиці.

Таблиця D
Дослідження *Alternaria* (на томатах) / захисна дія

Активна речовина	Витратна кількість активн. речов. в г/га	Ступінь дії в %
	750	100
	750	100

Приклад E

Дослідження *Erysiphe* (на ячмені) / захисна дія

Розчинник: 49ваг. частин N,N-диметилформаміду,

Емульгатор: 1ваг. частина аліларилполігліколевого етеру.

Для одержання необхідної композиції активних речовин 1 вагову частину активної речовини перемішують із вказаною кількістю розчинника та емульгатора, концентрат розріджують до необхідної концентрації водою.

Для дослідження захисної дії молоді рослини ячменю обприскують композицією активної речовини зазначеної витратної кількості. Через 1 день після обробки рослини заражають спорами *Erysiphe graminis* f. sp. *hordei*. Після цього рослини поміщають в інкубаційну камеру при температурі приблизно 18°C та відносній вологості повітря 70%.

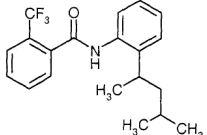
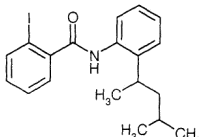
Через 7 днів після зараження проводять оцінку. При цьому, 0% означає ступінь дії, що відповідає

дає контрольним зразкам, в той час як ступінь дії 100% означає, що враження шкідниками не спостерігалось.

Активні речовини, витратні кількості та результати досліджень наведені нижче в таблиці.

Таблиця Е

Дослідження Erysiphe (на ячмені) / захисна дія

Активна речовина	Витратна кількість активн. речов. в г/га	Ступінь дії в %
	750	95
	750	95

Приклад F

Дослідження Russinia (на пшениці) / захисна дія

Розчинник: 25ваг. частин N,N-диметилформаміду,

Емульгатор: 0,6ваг. частин алкіларилполігліколевого етеру.

Для одержання необхідної композиції активних речовин 1 вагову частину активної речовини перемішують із вказаною кількістю розчинника та емульгатора, концентрат розріджують до необхідної концентрації водою.

Для дослідження захисної дії молоді рослини заражають суспензією спор Puccinia recondita в 0,1-ному розчині агару. Після висихання розчину рослини обприскують композицією активної речовини зазначеної витратної кількості. Рослини на 24 години поміщають в інкубаційну камеру при температурі 20°C та відносній вологості повітря 100%.

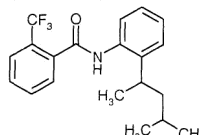
Після цього для оцінки розвитку пустул іржі рослини поміщають в теплицю при температурі приблизно 20°C та відносній вологості повітря 80%.

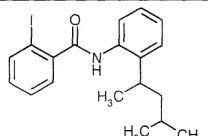
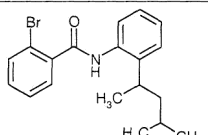
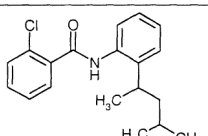
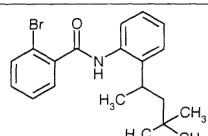
Через 10 днів після зараження проводять оцінку. При цьому, 0% означає ступінь дії, що відповідає контрольним зразкам, в той час як ступінь дії 100% означає, що враження шкідниками не спостерігалось.

Активні речовини, витратні кількості та результати досліджень наведені нижче в таблиці.

Таблиця F

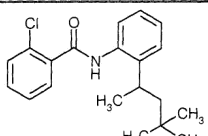
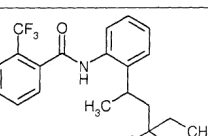
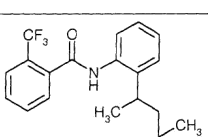
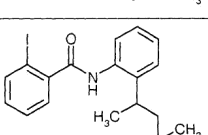
Дослідження Russinia (на пшениці) / захисна дія

Активна речовина	Витратна кількість активн. речов. в г/га	Ступінь дії в %
	500	100

	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

Таблиця F

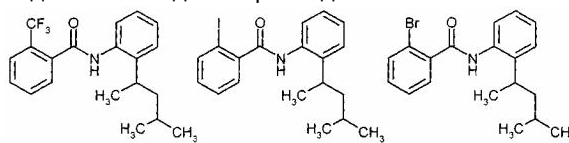
Дослідження Russinia (на пшениці) / захисна дія

Активна речовина	Витратна кількість активн. речов. в г/га	Ступінь дії в %
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

Приклад G

Спроби порівняння

У наведеній нижче таблиці порівняні сполуки згідно з винаходом з прикладів

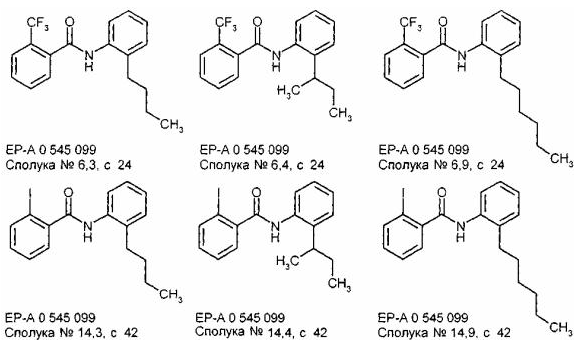


Прикл 2

Прикл 3

Прикл 5

з такими сполуками, відомими [з EP-A 0 545 099]:

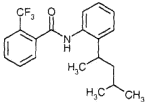
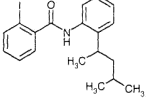
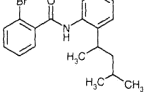


Сполуки порівнюють при проведенні досліджень згідно з прикладами застосування А [дослідження *Spaerothera* (на огірках) / захисна дія], D [дослідження *Alternaria* (на помідорах) / захисна дія] та E [дослідження *Erysiphe* (на ячмені) / захисна дія].

Витратні кількості становили відповідно 500м.ч. Ступені дії окремих сполук у відповідних прикладах застосування вказані нижче в таблиці.

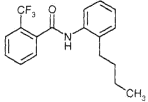
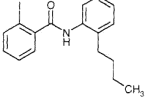
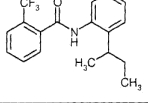
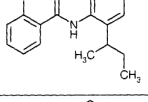
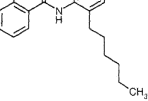
Таблиця G

Спроби порівняння

Активна речовина згідно з винаходом		Приклад А Дослідження <i>Spaerothera</i> (на огірках) захисна дія ступінь дії в %	Приклад D Дослідження <i>Alternaria</i> (на помідорах) захисна дія ступінь дії в %	Приклад E Дослідження <i>Erysiphe</i> (на ячмені) захисна дія ступінь дії в %
Прикл 2		100	95	90
Прикл 3		100	95	95
Прикл 5		95	90	30

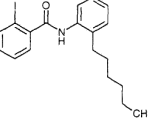
Таблиця G

Спроби порівняння

Сполуки, відомі з EP-A 0 545 099		Приклад А Дослідження <i>Spaerothera</i> (на огірках) захисна дія ступінь дії в %	Приклад D Дослідження <i>Alternaria</i> (на помідорах) захисна дія ступінь дії в %	Приклад E Дослідження <i>Erysiphe</i> (на ячмені) захисна дія ступінь дії в %
№ 6,3 (с. 24)		10	0	10
№ 14,3 (с. 42)		0	0	0
№ 6,4 (с. 24)		30	30	0
№ 14,4 (с. 42)		10	10	20
№ 6,9 (с. 24)		0	0	0

Таблиця G

Спроби порівняння

№ 14,9 (с. 42)		0	0	0
-------------------	--	---	---	---