



УКРАЇНА

(19) UA (11) 59380 (13) C2

(51) 7 C07D239/52,239/56, A01N43/54

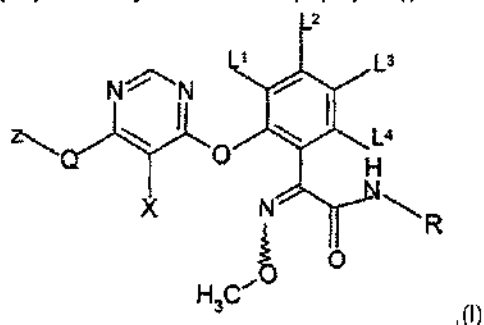
МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) ГАЛОГЕНПІРИМІДИНІЛАРИЛ(ТІО)ЕТЕРИ, ЗАСІБ ТА СПОСІБ БОРОТЬБИ З ШКІДНИКАМИ, ПРОМІЖНІ СПОЛУКИ

1

2

- (21) 99063223
(22) 29 10 1997
(24) 15 09 2003
(86) PCT/EP97/05954, 29 10 1997
(31) 196 46 407 2
(32) 11 11 1996
(33) DE
(46) 15 09 2000, Бюл. № 9, 2003 р
(72) Гайєр Герберт, DE, Гердес Петер, DE, Хай-
неманн Ульріх, DE, Крюгер Бернд-Віланд, DE,
Тіманн Ральф, DE, Дутцманн Штефан, DE, Хен-
сслер Герд, DE, Штенцель Клаус, DE
(73) БАЙЕР АКЦІЕНГЕЗЕЛЛЬШАФТ, DE
(56) DE, 4443641, A, 1996
GB, 2253624, A, 1992
EP, 0647831, A, 1995
EP, 0398692, A, 1990
(57) 1. Сполуки загальної формули (I)



в якій

Z означає заміщений або незаміщений циклоалкіл,
арил або гетероцикліл,

R означає водень або алкіл,

Q означає кисень або сірку,

X означає галоген і

L¹, L², L³, L⁴-однакові або різні і, незалежно один
від одного, означають відповідно водень, галоген,
ціаногрупу, нітрогрупу, заміщений або незаміще-
ний галогеном алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсуль-
фоніл або алкілсульфоніл

2. Сполуки формули (I) згідно з п. 1, в якій

Z означає циклоалкіл з 3-7 атомами вуглецю, не-
заміщений або заміщений в одному або двох по-
ложеннях галогеном, алкілом або гідроксилом,
означає гетероцикліл з кількістю ланцюгів від 3 до
7, при необхідності заміщений алкілом з 1-4 ато-

мами вуглецю,

або означає незаміщений або заміщений однаково
або по-різному у положеннях від одного до чо-
тирьох феніл або нафтил, причому можливі
замісники вибрані переважно із перелічених ниж-
чегалоген, ціан, нітро, аміно, гідрокси, форміл, кар-
бокиси, карбамоіл, tioкарбамоіл,лінійний або розгалужений алкіл, гідроксialкіл,
оксоалкіл, алкокси, алкоксialкіл, алкілтіоalкіл,діалкоксialкіл, алкілтіо, алкілсульфоніл або алкіл-
сульфоніл з кількістю атомів вуглецю від 1 до 8,лінійний або розгалужений алкеніл або алкенілокси
з кількістю атомів вуглецю від 2 до 6,лінійний або розгалужений галогеналкіл, галоген-
алкокси, галогеналкілтіо, галогеналкілсульфоніл
або галогеналкілсульфоніл з кількістю атомів вуг-
лецю від 1 до 6 і з кількістю від 1 до 13 однаковихабо різних атомів галогену,
лінійний або розгалужений галогеналкіл або гало-
геналкенілокси з кількістю атомів вуглецю від 2 до6 і з кількістю від 1 до 11 однакових або різних
атомів галогену,лінійний або розгалужений алкіламіно, діалкіламі-
но, алкілкарбоніл, алкілкарбонілокси, алкоксикар-
боніл, алкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбоніл,арилалкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбонілокси,
алкенілкарбоніл або алкінілкарбоніл з кількістю
атомів вуглецю від 1 до 6 у відповідних вуглевод-
невих ланцюгах,циклоалкіл або циклоалкілокси з кількістю атомів
вуглецю від 3 до 6,двічі приєднані алкілен з кількістю атомів вуглецю
3 або 4, оксіалкілен з кількістю атомів вуглецю 2
або 3 або діоксіалкілен з кількістю атомів вуглецю
1 або 2, які незаміщені або заміщені у положеннях
від одного до чотирьох однаково або по-різному
фтором, хлором, оксогрупою, метилом, трифтор-
метилом або етилом,

або група

циклоалкіл або циклоалкілокси з кількістю атомів
вуглецю від 3 до 6,двічі приєднані алкілен з кількістю атомів вуглецю
3 або 4, оксіалкілен з кількістю атомів вуглецю 2
або 3 або діоксіалкілен з кількістю атомів вуглецю
1 або 2, які незаміщені або заміщені у положеннях
від одного до чотирьох однаково або по-різному
фтором, хлором, оксогрупою, метилом, трифтор-
метилом або етилом,

або група

циклоалкіл або циклоалкілокси з кількістю атомів
вуглецю від 3 до 6,двічі приєднані алкілен з кількістю атомів вуглецю
3 або 4, оксіалкілен з кількістю атомів вуглецю 2
або 3 або діоксіалкілен з кількістю атомів вуглецю
1 або 2, які незаміщені або заміщені у положеннях
від одного до чотирьох однаково або по-різному
фтором, хлором, оксогрупою, метилом, трифтор-
метилом або етилом,

або група

циклоалкіл або циклоалкілокси з кількістю атомів
вуглецю від 3 до 6,двічі приєднані алкілен з кількістю атомів вуглецю
3 або 4, оксіалкілен з кількістю атомів вуглецю 2
або 3 або діоксіалкілен з кількістю атомів вуглецю
1 або 2, які незаміщені або заміщені у положеннях
від одного до чотирьох однаково або по-різному
фтором, хлором, оксогрупою, метилом, трифтор-
метилом або етилом,

або група

циклоалкіл або циклоалкілокси з кількістю атомів
вуглецю від 3 до 6,двічі приєднані алкілен з кількістю атомів вуглецю
3 або 4, оксіалкілен з кількістю атомів вуглецю 2
або 3 або діоксіалкілен з кількістю атомів вуглецю
1 або 2, які незаміщені або заміщені у положеннях
від одного до чотирьох однаково або по-різному
фтором, хлором, оксогрупою, метилом, трифтор-
метилом або етилом,

(13) C2

(11) 59380

(19) UA

кількістю атомів вуглецю від 1 до 6, і

A² означає гідроксигрупу, аміногрупу, метиламіногрупу, феніл, бензил або означає алкіл або алкокси з кількістю атомів вуглецю від 1 до 4, незаміщений чи заміщений ціаногрупою, гідроксигрупою, алкоксигрупою, алкілгідрогрупою, алкіламіногрупою, діалкіламіногрупою або фенілом, або означає алкенилокси або алкінілокси з кількістю атомів вуглецю від 2 до 4,

а також феніл, фенокси, фенілтію, бензоіл, бензоілетеніл, ціннамоіл, гетероцикліл або фенілакіл, фенілакілтію, фенілакілтію або гетероциклілакіл з кількістю атомів вуглецю від 1 до 3 в кожній алкілній частині, до того ж цикл в кожному випадку незаміщений або заміщений у положеннях від одного до трьох галогеном і/або лінійним чи розгалуженим алкілом або алкоксигрупою з кількістю атомів вуглецю від 1 до 4,

R означає водень або метил,

Q означає кисень або сірку,

X означає фтор, хлор, бром або йод і

L¹, L², L³ і L⁴-однакові або різні і означають незалежно один від одного водень, галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, незаміщені або заміщені від 1 до 5 атомами галогену алкіл, алкокси, алкілтію, алкілсульфініл або алкілсульфоніл з кількістю атомів вуглецю від 1 до 6

3 Сполуки формули (I), згідно з п. 1, в якій

Z означає незаміщений або заміщений в одному або двох положеннях фтором, хлором, метилом, етилом або гідроксигрупою циклопентил або циклогексил,

незаміщений або заміщений метилом або етилом тієніл, піридил або фурил,

або незаміщений чи заміщений однаково або по-різному у положеннях від одного до чотирьох феніл або нафтил, причому можливі замісники вибрані переважно із перелічених нижче

фтор, хлор, бром, йод, ціано, нітро, аміно, гідрокси, форміл, карбокси, карбамоіл, тіокарбамоіл, метил, етил, н- або ізопропіл, н-, ізо, втор- або третбутил, 1-, 2-, 3-неопентил, 1-, 2-, 3-, 4-(2-метилбутил), 1-, 2-, 3-гексил, 1-, 2-, 3-, 4-, 5-(2-метилпентил), 1-, 2-, 3-(3-метилпентил), 2-етилбутил, 1-, 3-, 4-(2,2-диметилбутил), 1-, 2-(2,3-диметилбутил), гідроксиметил, гідроксietил, 3-оксобутил, метоксиметил, диметоксиметил, метокси, етокси, н- або ізопропокси,

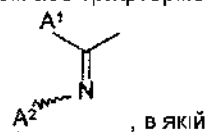
метилтію, етилтію, н- або ізопропілтію, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл,

вініл, аліл, 2-метилаліл, пропен-1-іл, кротоніл, пропаріл, вінілокси, алілокси, 2-метилалілокси, пропен-1-ілокси, кротонілокси, пропаргілокси,

трифторметил, трифторетил, дифторметокси, трифторметокси, дифторхлорметокси, трифторетокси, дифторметилтію, трифторметилтію, дифторхлорметилтію, трифторметилсульфініл або трифторметилсульфоніл,

метиламіно, етиламіно, н- або ізопропіламіно, диметиламіно, діетиламіно, ацетил, пропіоніл, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, метиламінокарбоніл, етиламінокарбоніл, диметиламінокарбоніл, діетиламінокарбоніл, диметиламінокарбонілокси, діетиламінокарбонілокси, бензиламінокарбоніл, акрилол, пропіолол, циклопентил, циклогексил, двічі

приєднані пропанділ, етиленокси-, метилендіокси-, етилендіоксигрупа, незаміщена або заміщена однаково або по-різному у положеннях від одного до чотирьох фтором, хлором, оксогрупою, метилом або трифторметилом, або група



в якій A¹ означає водень, метил або гідроксигрупу і

A² означає гідроксигрупу, метоксигрупу, етоксигрупу, аміногрупу, метиламіногрупу, феніл, бензил або гідроксietил, а також

незаміщений або заміщений в кільці у положеннях від одного до трьох галогеном і/або прямим чи розгалуженим алкілом або алкоксигрупою з кількістю атомів вуглецю від 1 до 4 феніл, фенокси, фенілтію, бензоіл, бензоілетеніл, ціннамоіл, бензил, фенілетил, фенілпропіл, бензілокси, бензилтію, 5,6-дигідро-1,4,2-діоксазин-3-ілметил, триазолілметил, бензоксазол-2-ілметил, 1,3-діоксан-2-іл, бензімідазол-2-іл, діоксол-2-іл, оксодіазоліл, R означає водень або, переважно, метил, Q означає кисень або сірку,

X означає фтор або хлор, і

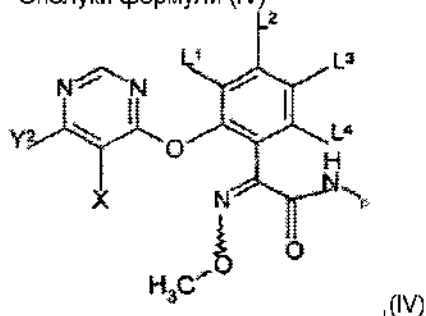
L¹, L², L³ і L⁴-однакові або різні і, незалежно один від одного, означають водень, фтор, хлор, бром, ціаногрупу, нітрогрупу, метил, етил, н- або ізопропіл, н-, ізо-, втор- або третбутил, метокси, етокси, н- або ізопропілокси, метилтію, етилтію, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл, трифторметил, трифторетил, дифторметокси, трифторметокси, дифторхлорметокси, трифторетокси, дифторметилтію, дифторхлорметилтію, трифторметилтію, трифторметилсульфініл або трифторметилсульфоніл

4 Сполуки формули (I) згідно з п. 1, в якій Q означає кисень

5 Засіб боротьби з шкідниками, який відрізняється тим, що містить щонайменше сполуку формули (I) згідно з п. 1

6 Спосіб боротьби з шкідниками, який відрізняється тим, що шкідників і/або їх місце проживання обробляють сполуками формули (I)

7 Сполуки формули (IV)



в якій

L¹, L², L³, L⁴-однакові або різні і, незалежно один від одного, означають відповідно водень, галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, заміщений або незаміщений галогеном алкіл, алкокси, алкілтію, алкілсульфініл або алкілсульфоніл,

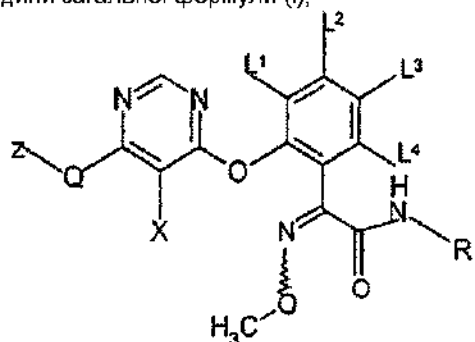
R означає водень або алкіл,

X означає галоген, і

Y² означає галоген

Винахід стосується нових галогенпіримідинів, двох способів їх одержання і їх застосування в якості засобу для боротьби із шкідниками.

Визначені піримідини з похжим заміщенням замісників, а також їх фунгіцидна дія стала вже відома (GB-A 2253624). Активність цих відомих сполук є задовільною не у всіх галузях застосування, особливо при використанні малих кількостей і концентрацій. Було одержано нові галогенпіримідини загальної формули (I),



в якій

Z означає заміщений або незаміщений циклоалкіл, арил або гетероциклі,

R означає водень або алкіл,

Q означає кисень або сірку,

X означає галоген і

L¹, L², L³, L⁴ однакові або різні і, незалежно один від одного, означають відповідно водень, галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, заміщений або незаміщений галогеном алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл або алкілсульфоніл.

У використаних тут визначеннях насичених або ненасичених — вуглеводневих ланцюгів таких, як алкіл, алканділ, алкеніл або алкініл, також і зв'язані з гетероатомами, як наприклад алкокси-, алкілтіо- або алкіламіно-ланцюг залежно від обставин прямий або розгалужений.

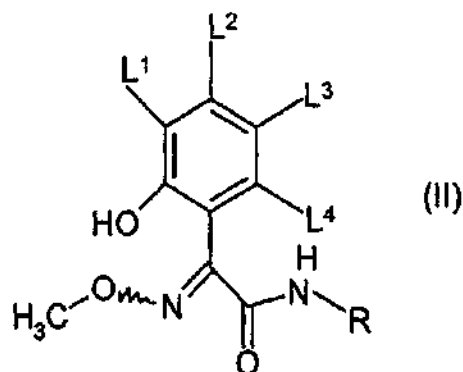
Арил означає ароматичне, моно- або поліциклічне вуглеводнєве кільце, наприклад феніл, нафтил, антрапіл, фенантріл, переважно феніл або нафтил, більш переважно феніл.

Гетероциклі означає насичені або ненасичені, а також ароматичні циклічні сполуки, в яких, мінімум один ланцюг циклу є гетероатомом, тобто є атомом відмінним від вуглецю. Якщо цикл містить декілька гетероатомів, то вони можуть бути однакові або різні. Переважно коли гетероатомом є атом кисню, азоту або сірки. При необхідності, циклічні сполуки можуть утворювати з іншими карбоциклічними або гетероциклічними конденсованими або містечковими циклами єдину поліциклічну систему. Переважно моно- або біциклічну циклічну систему, більш переважно моно- або біциклічну ароматичну циклічну систему.

Циклоалкіл означає насичені карбоциклічні кільцеподібні сполуки, які при необхідності утворюють з іншими карбоциклічними, неконденсованими або містечковими циклами поліциклічну систему.

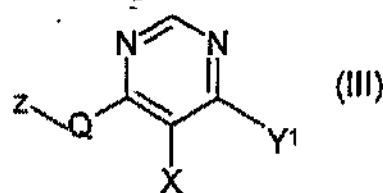
Надалі було знайдено, що нові галогенпіримі-

дини загальної формули (I) можна одержати, коли а) 2-(2-гідрокси-феніл)-2-метоксиімідно-ацетаміди формули (II),



(i)

в якій R, L¹, L², L³ і L⁴ мають вищевказані значення, взаємодіють із заміщеним галогенпіримідином загальної формули III,



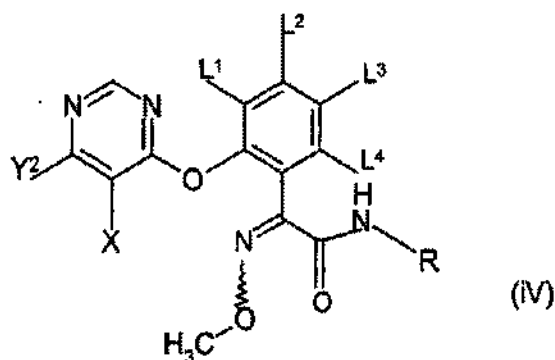
в якій

Z, Q і X мають значення як вказані вище і

Y¹ означає галоген,

реакція проходить при необхідності в присутності розчинника, при необхідності в присутності кислотного акцептора і при необхідності в присутності катализатора, або коли

б) феноксіпіримідини загальної формули (IV)



в якій

R, L¹, L², L³ і L⁴ мають вищевказані значення і

Y² означає галоген,

взаємодіє з циклічними сполуками загальної формули (V),

Z-Q-H (V),

в якій

Z і Q мають значення як вказані вище,

реакція проходить при необхідності в присутності розчинника, при необхідності в присутності кислотного акцептора і при необхідності в присутності катализатора

Нарешті було знайдено, що нові галогенпримідини загальної формули (I) виявляють дуже сильну фунгіцидну активність

Сполуки, згідно винаходу, можуть при необхідності використовуватись у вигляді сумішей різних можливих ізомерних форм, переважно в формі стереоізомерів, як наприклад E- і Z-ізомери. Так використовують як E- так і Z-ізомери, а також будь-які суміші цих ізомерів

Предметом винаходу є переважно сполуки формули (I), в яких

Z означає циклоалкіл з 3-7 атомами вуглецю, незаміщений або заміщений в одному або двох положеннях галогеном, алкілом або гідроксилом,

означає гетероцикліл з кількістю ланцюгів від 3 до 7, при необхідності заміщений алкілом з 1-4 атомами вуглецю,

або означає незаміщений або заміщений однаково або різно в від одного до чотирьох положеннях феніл або нафтил, при чому можливі замінники вибрані переважно із перелічених нижче

галоген, ціан, нітро, зміно, гідрокси, форміл, карбокси, карбамоіл, tioкарбамоіл,

прямолінійний або розгалужений алкіл, гідроксиалкіл, оксоалкіл, алкокси, алкоксиалкіл, алкілтіоалкіл, діалкоксиалкіл, алкілтіо, алкілсульфініл або алкілсульфоніл з кількістю атомів вуглецю від 1 до 8,

прямолінійний або розгалужений алкеніл або алкенілокси з кількістю атомів вуглецю від 2 до 6,

прямолінійний або розгалужений галогеналкіл, галогеналкокси, галогеналкілтіо, галогеналкілсульфініл або галогеналкілсульфоніл з кількістю атомів вуглецю від 1 до 6 і з кількістю від 1 до 13 однаковими або різними атомами галогену,

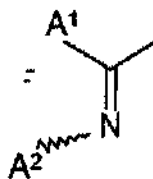
прямолінійний або розгалужений галогеналкіл або галогеналкенілокси з кількістю атомів вуглецю від 2 до 6 і з кількістю від 1 до 11 однаковими або різними атомами галогену,

прямолінійний або розгалужений алкіламіно, діалкіламіно, алкілкарбоніл, алкілкарбонілокси, алкоксикарбоніл, алкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбоніл, ариалкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбонілокси,

алкенілкарбоніл або алкілкарбоніл з кількістю атомів вуглецю від 1 до 6 у відповідних вуглеводневих ланцюгах,

циклоалкіл або циклоалкілокси з кількістю атомів вуглецю від 3 до 6, двічі приєднанні алкілен з кількістю атомів вуглецю 3 або 4, оксиалкілен з кількістю атомів вуглецю 2 або 3 або діоксиалкілен з кількістю атомів вуглецю 1 або 2, які незаміщений або заміщений в від одного до чотирьох положеннях однаково або різно фтором, хлором, оксогрупою, метилом, трифторметилом або етилом,

або група



в якій

A¹ означає водень, гідроксигрупу або алкіл з кількістю атомів вуглецю від 1 до 4 або циклоалкіл з кількістю атомів вуглецю від 1 до 6 і

A² означає гідроксигрупу, аміногрупу, метиламіногрупу, феніл, бензил або означає алкіл або алкокси з кількістю атомів вуглецю від 1 до 4 незаміщений чи заміщений ціаногрупою, гідроксигрупою, алкоксигрупою, алкілтіогрупою, алкіламіногрупою, діалкіламіногрупою або фенілом або означає алкенілокси або алкілнілокси з кількістю атомів вуглецю від 2 до 4,

а також феніл, фенокси, фенілтіо, бензоіл, бензоїлетеніл, ціннамоіл, гетероцикліл або фенілалкіл, фенілалкокси, фенілалкілтіо, або гетероциклілалкіл з кількістю атомів вуглецю від 1 до 3 в кожній алкілній частині, до того ж цикл в кожному випадку незаміщений або заміщений в від одного до трьох положеннях галогеном і/або прямолінійним чи розгалуженим алкілом або алкоксигрупою з кількістю атомів вуглецю від 1 до 4,

R означає водень або метил,

Q означає кисень або сірку,

X означає фтор, хлор, бром або йод і

L¹, L², L³ і L⁴ однакові або різні і, означають незалежно один від одного водень, галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, незаміщені або заміщені від 1 до 5 атомами галогену алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл або алкілсульфоніл з кількістю атомів вуглецю від 1 до 6

Винахід стосується переважно сполук формули (I), в якій

Z означає незаміщений або заміщений в одному або двох положеннях фтором, хлором, метилом, етилом або гідроксигрупою циклопентил або циклогексил,

незаміщений або заміщений метилом або етилом тіеніл, піридил або фурил,

або незаміщений чи заміщений однаково або різно в від одного до чотирьох положеннях феніл або нафтил, при чому можливі замінники вибрані переважно із перелічених нижче *

фтор, хлор, бром, йод, ціано, нітро, зміно, гідрокси, форміл, карбокси, карбамоіл, tioкарбамоіл, метил, етил, n- або ізо-пропіл, n-, ізо-, втор- або трет-бутил, 1-, 2-, 3-, неопентил, 1-, 2-, 3-, 4-(2-метилбутил), 1-, 2-, 3-гексил, 1-, 2-, 3-, 4-, 5-(2-метилпентил), 1-, 2-, 3-(3-метилпентил), 2-етилбутил, 1-, 3-, 4-(2, 2-диметилбутил), 1-, 2-(2, 3-диметилбутил), гідроксиметил, гідроксietил, 3-оксобутил, метоксиметил, диметоксиметил,

метокси, етокси, n- або ізо-пропілокси,

метилтіо, етилтіо, n- або ізо-пропілтіо, метилсульфініл, етил сул ьфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл,

вініл, аліл, 2-метилаліл, пропен-1-іл, кротоніл, пропаріл, вінілокси, алілокси, 2-метилалілокси, пропен-1-ілокси, кротонілокси, пропаргілокси,

трифторметил, трифторетил,
диформетокси, трифторметокси, дифторхлор-
метокси, трифторетокси, дифторметилтіо, три-
фторметилтіо, дифторхлорметилтіо, трифторме-
тилсульфініл або трифторметилсульфоніл,

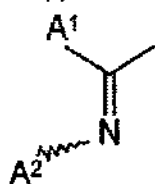
метиламіне, етиламіно, н- або ізо-пропіламіно,
диметиламіне, диетиламіно,

ацетил, пропіоніл, метоксикарбоніл, етоксика-
рбоніл, метиламінокарбоніл, етиламінокарбоніл,
диметиламінокарбоніл, диетиламінокарбоніл, ди-
метиламінокарбонілокси, диетиламінокарбонілокс-
и, бензиламінокарбоніл, акроіл, пропіолоіл,

циклопентил, циклогексил,

двічі приєднанні пропанділ, етиленокси-, ме-
тилендіокси-, етилендіоксигрупа незаміщена або
заміщена однаково або різно в від одного до чоти-
рьох положеннях фтором, хлором, оксогрупою,
метилом або трифторметилом,

або група



в якій

A¹ означає водень, метил або гідроксигрупу і

A² означає гідроксигрупу, метоксигрупу, еток-
сигрупу, аміногрупу, метиламіногрупу, феніл, бен-
зил або гідроксиетил, а також

незаміщений або заміщений в кільці в від од-
ного до трьох положеннях галогеном і/або прямим
чи розгалуженим алкілом або алкоксигрупою з
кількістю атомів вуглецю від 1 до 4, феніл, фено-
кси, фенілтіо, бензоіл, бензоілетеніл, циннамоіл,
бензил, фенілети́л, фенілпропіл, бензидокси, бен-
зилтіо, 5,6-дигідро-1,4,2-діоксазин-3-ілметил, три-
азоліл-метил, бензаксазол-2-ілметил, 1,3-діоксан-
2-іл, бензімідазол-2-іл, діоксол-2-іл, оксодіазоліл,

R означає водень або, переважно метил,

Q означає кисень або сірку,

X означає фтор або хлор, і

L¹, L², L³ і L⁴ однакові або різні і, незалежно
один від одного означають водень, фтор, хлор,
бром, ціаногрупу, нітрогрупу, метил, етил, н- або
ізо-пропіл, н-, ізо-, втор- або трет-бутил, метокси,
етокси, н- або ізо-пропіл-окси, метилтіо, етилтіо,
метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл
або етилсульфоніл, трифторметил, трифторетил,
диформетокси, трифторметокси, дифторхлорме-
токси, трифторетокси, дифторметолтіо, дифторх-
лорметилтіо, трифторметилтіо, трифторметилсуль-
фініл або трифторметилсульфоніл

В цілому більш переважають групи сполук в
яких Z означає незаміщений або заміщений феніл

Надалі в цілому більш переважають групи
сполук в яких L¹ і L³ означають незалежно один від
одного метил і, переважно водень і, L² і L⁴ означа-
ють водень

Більш переважають сполуки формули (I) в
яких X переважно означає фтор

Вищенаведені загальні або переважні області
вказаних визначених радикалів дійсні як для кін-
цевих продуктів формули (I), так і відповідно для

потрібних вихідних речовин і проміжних продуктів

Будь які, відповідно, переважні комбінації ра-
дикалів, що наведені в описі радикалів можуть
бути, незалежно від наведених комбінацій радика-
лів, замінені довільно, виходячи із опису радикалів
для інших переважних галузей застосування

Ці визначені радикали можна комбінувати між
собою будь-як, а також між вказаними ділянками
для переважних сполук

Для проведення способу а) згідно винаходу в
якості вихідної речовини необхідно брати 2-(2-
гідроксифеніл)-2-метоксиіміно-ацетамід формули
(II) В цій формулі (II) радикали R, L¹, L², L³ і L⁴ пе-
реважно мають значення, які вже відомі з опису
сполук згідно винаходу формули (I), як переважні
або інакше більш переважні для R, L¹, L², L³ і L⁴

Вихідні речовини формули (II) вже відомі і мо-
жуть бути одержані відомими способами (порівня-
ти, наприклад, WO - A 9524396)

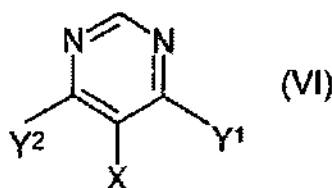
Для проведення способу а) згідно винаходу
надалі в якості вихідної речовини необхідно брати
галогенпіримідин формули (III) В цій формулі (III)
радикали Z, Q і X переважно мають значення, які
вже відомі з опису сполук згідно винаходу форму-
ли (I), як переважні або інакше більш переважні Y¹
означає галоген, переважно фтор або хлор

Вихідні речовини формули (III) вже відомі і
можуть бути одержані відомими методами (порів-
няти, наприклад, DE-A 4340181, Chem Ber, 90
<1957>942, 951)

Для проведення способу б) згідно винаходу в
якості вихідної речовини необхідно брати фенок-
сипіримідин загальної формули (IV) В цій формулі
(IV) радикали R, X, L¹, L², L³ і L⁴ переважно мають
значення, які вже відомі з опису сполук згідно ви-
находу формули (I), як переважні або інакше більш
переважні для R, X, L¹, L², L³ і L⁴ Y² означає гало-
ген, переважно фтор або хлор

Вихідні речовини формули (IV) є новими і та-
кож є предметом даного винаходу

Феноксипіримідини загальної формули (IV)
одержують (спосіб 6-1) коли 2-(2-гідроксифеніл)-2-
метоксиіміноацетамід формули (II) взаємодіє з
тригалогенпіримідинном загальної формули (VI)



в якій

X, Y¹ і Y² однакові або різні і означають гало-
ген, при необхідності, в присутності акцептора ки-
слоти і при необхідності в присутності каталізатора

Для проведення способу б-1), згідно винаходу,
в якості вихідної речовини необхідно брати трига-
логенпіримідин загальної формули (VI) В цій фо-
рмулі (VI) радикали X, Y¹ і Y² означають галоген,
переважно фтор або хлор

Тригалогенпіримідини вже відомі і можуть бути
одержані відомими методами (порівняти, напри-
клад, Chesterfield et al, J Chem Soc, 1955, 3478,
3480)

Надалі для проведення способу б), згідно винаходу, в якості вихідної речовини необхідно брати циклічні сполуки загальної формули (V). В цій формулі (V) радикали Z і Q переважно мають значення, які вже відомі з опису сполук згідно винаходу формули (I), як переважні або, інакше, більш переважні для Z і Q.

Циклічні сполуки формули (V) є відомими хімікатами для синтезу і/або можуть бути одержані простими методами.

В якості розчинника для проведення способів а), б) і б-1), згідно винаходу, беруть до уваги будь-які інертні органічні розчинники. Для цього необхідно брати переважно етер такий, як диетилетер, диізопропілетер, метил-трет-бутилетер, диоксан, тетрагидрофуран, 1,2-диметоксиетан, 1,2-диетоксиетан або анізол, нтрин такий, як ацетонітрил, пропіонітрил, n- або ізо-бутиронітрил або бензонітрил, аміл такий, як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метилформамід, N-метилформамід, N-метилпіролідон або триамід гексаметилфосфорної кислоти, сульфоксид такий, як диметилсульфоксид, або сульфон такий, як сульфолан.

Способи а), б) і б-1), згідно винаходу, проводять при необхідності в присутності придатного акцептора кислоти. В якості таких придатні всі загальноновживані неорганічні або органічні основи. Для цього необхідно брати гідриди, гідроксиди, алкогولاتи, карбонати або гідрогенкарбонати лужних або лужноземельних металів такі, як наприклад гідрид натрію, амід натрію, третбутират калію, гідроксид натрію, гідроксид калію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрогенкарбонат калію або гідрогенкарбонат натрію.

В якості каталізаторів для способів а), б) і б-1), згідно винаходу, придатні всі солі одновалентної міді такі, як, наприклад, хлорид одновалентної міді, бромід одновалентної міді або йодид одновалентної міді.

Температура реакції при проведенні способів а), б) і б-1), згідно винаходу, може варіювати у великих межах. Як правило, працюють при температурах від -20°C до 100°C, більш переважно, при температурах від 10°C до 80°C.

Для проведення способу а), згідно винаходу, щоб одержати сполуки формули (I) використовують на один моль 2-(2-гідрокси-феніл)-2-метоксиіміноацетаміду формули (II), як правило, від 0,5 до 15 моль, переважно від 0,8 до 8 моль заміщеного галогенпіримідину формули (III).

Для проведення способу б), згідно винаходу, щоб одержати сполуки формули (I) використовують на один моль феноксіпіримідину формули (IV), як правило, від 0,5 до 15 моль, переважно від 0,8 до 8 моль циклічної сполуки загальної формули (V).

Для проведення способу б-1), згідно винаходу, щоб одержати сполуки формули (IV) використовують на один моль 2-(2-гідрокси-феніл)-2-метоксиіміноацетаміду формули (II), як правило, від 1 до 15 моль, переважно від 2 до 8 моль тригалогенпіримідину загальної формули (VI).

Всі способи, згідно винаходу, проводять, як правило, при нормальному тиску. Але, все-таки, також можливо працювати при збільшеному або

зменшеному тиску в інтервалі від 0,1 бар до 10 бар.

Проведення реакції, переробка і виділення продуктів реакції здійснюють загальновідомими способами (порівняти також приклади одержання речовин).

Речовини, згідно винаходу, показують сильну мікробіцидну активність і можуть бути використані для боротьби з небажаними мікроорганізмами, такими, як грибки і бактерії при захисті рослин і при захисті матеріалів.

Фунгіциди використовують при захисті рослин для боротьби з *Plasmodiophoromycetes*, *Oomycetes*, *Chytridiomycetes*, *Zygomycetes*, *Ascomycetes*, *Basidiomycetes* і *Deuteromycetes*.

Бактерициди використовують при захисті рослин для боротьби з *Psuedomonadaceae*, *Rhizobiaceae*, *Enterobacteriaceae*, *Corynebacteriaceae* і *Streptomycetaceae*.

Як приклад можна привести деякі збудники грибкових і бактеріальних захворювань, але не обмежуючись ними, які підпадають під вищенаведені поняття.

вид *Xanthomonas*, як наприклад *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*,

вид *Pseudomonas*, як наприклад *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*,

вид *Erwinia*, як наприклад *Erwinia amylovora*,

вид *Pythium*, як наприклад *Pythium ultimum*,

вид *Phytophthora*, як наприклад *Phytophthora infestans*,

вид *Pseudoperonospora*, як наприклад *Pseudoperonospora humuli* або *Pseudoperonospora cubensis*,

вид *Plasmopara*, як наприклад *Plasmopara viticola*,

вид *Bremia*, як наприклад *Bremia lactucae*,

вид *Peronospora*, як наприклад *Peronospora pisi* або *P. blasticcae*,

вид *Erysiphe*, як наприклад *Erysiphe graminis*,

вид *Sphaeroteca*, як наприклад *Sphaeroteca fuliginea*,

вид *Podosphaera*, як наприклад *Podosphaera leucotricha*,

вид *Venturia*, як наприклад *Venturia inaequalis*,

вид *Pyrenophora*, як наприклад *Pyrenophora teres* або *P. graminea* (Konidienform *Drechslera*, Syn *Helminthosporium*),

вид *Cochliobolus*, як наприклад *Cochliobolus sativus* (Konidienform *Drechslera*, Syn *Helminthosporium*),

вид *Uromyces*, як наприклад *Uromyces appendiculatus*,

вид *Puccinia*, як наприклад *Puccinia recondita*,

вид *Sclerotinia*, як наприклад *Sclerotinia sclerotiorum*,

вид *Tilletia*, як наприклад *Tilletia caries*,

вид *Ustilago*, як наприклад *Ustilago nuda* або *Ustilago avenae*,

вид *Pellicularia*, як наприклад *Pellicularia sakaii*,

вид *Pyricularia*, як наприклад *Pyricularia oryzae*,

вид *Fusarium*, як наприклад *Fusarium culmorum*,

вид *Botrytis*, як наприклад *Botrytis cinerea*,

вид *Septoria*, як наприклад *Septoria nodorum*,

вид *Leptosphaeria*, як наприклад *Leptosphaeria*

nodorum,

вид *Cercospora*, як наприклад *Cercospora canescens*,

вид *Alternaria*, як наприклад *Alternaria brassicae*,

вид *Pseudocercospora*, як наприклад *Pseudocercospora herpotrichoides*

Добра переносимість рослинами активних речовин в концентраціях, необхідних для боротьби з хворобами рослин, дозволяє обробку наземних частин рослин, розсади і насіння і ґрунту

При цьому є можливість використовувати активні речовини, згідно винаходу, досягаючи особливо добрих результатів при боротьбі з хворобами зернових культур, наприклад при боротьбі з такими видами, як *Erysiphe*, *Russcisia*, *Fusarium* і *Pyrenophora*, для боротьби з хворобами у виноградарстві, садівництві та овочівництві, наприклад при боротьбі з такими видами, як наприклад *Venturia*, *Sphaeroteca* і *Plasmopara*, *Phytophthora* або для боротьби з хворобами рису, наприклад при боротьбі з такими видами, як *Pyricularia*. Добрих результатів досягають також при боротьбі з хворобами зернових культур, наприклад при боротьбі з такими видами як *Septoria*, *Pyrenophora* або *Cochliobolus*. Подальші використання сполук, згідно винаходу, також приводить до збільшення урожайності культурних рослин

Активні речовини можуть, в залежності від їх відповідних фізичних і/або хімічних властивостей, переводитись в загальноприйнятні форми використання такі, як розчини, емульсії, суспензії, порошки, піни, пасти, гранули, аерозолі, мілкі капсули в полімерних речовинах, покритих масах для посівного матеріалу, а також форми дуже малих об'ємів для створення холодного і теплого туману

Ці форми застосування виготовлялись відомим способом, наприклад, змішуванням активних речовин з нейтральним наповнювачем, отже рідкими розчинниками під тиском стоячих зріджених газів і/або твердих речовин носіїв у випадку необхідності при застосуванні поверхнево-активних засобів, відповідно емульгуючих і/або диспергуючих і/або піноутворюючих засобів. У випадку використання води, як нейтрального наповнювача можна наприклад застосовувати також органічний розчинник в якості додаткового розчинника. В якості рідкого розчинника в основному беруть ароматичні такі, як ксилол, толуол або алкіл нафталін, хлоровані ароматичні або хлоровані аліфатичні вуглеводи такі, як хлорбензол, хлоретипен або метипенхлорид, аліфатичні вуглеводи такі, як циклогексан або парафіни, наприклад фракції нафта, спирти такі, як бутанол або гліколь, а також етери і естери, кетони такі, як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон або циклогексанон, дуже полярні розчинники такі, як диметилформамід і диметилсульфоксид, а також воду. Звичайні зріджені газоподібні нейтральні наповнювачі або речовини носії це такі рідини, які при нормальній температурі і нормальному тиску газоподібні, наприклад гази, всліваючі аерозолі такі, як галогенвуглеводні, а також бутан, пропан, азот і диоксид вуглецю. В якості твердих речовин-носіїв беруть наприклад, тонкоподрібнену прську породу таку, як каолін, глинозем, тальк, крейда, кварц, атапульгіт, монт-

морілоніт, або діатоміт і синтетичну тонкоподрібнену породу таку як вискодиспергована кремнієва кислота, оксид алюмінію і силікат. В якості твердих речовин-носіїв для гранулята беруть наприклад, подрібнене і фракціоноване природне каміння таке як кальцит, мармур, пемза, сепіоліт, доломіт, а також синтетичний гранулят із неорганічного і органічного борошна, а також гранулят із змелених органічних матеріалів таких, як стружки, шкаралупа кокосового горіха, качан кукурудзи і стебла тютюну. В якості емульгатора і/або піноутворюючого засобу беруть наприклад, неіоногенні і аніонні емульгатори такі, як поліоксиетиленовий естер жирних кислот, поліоксиетиленовий етер вищих спиртів наприклад, алкіларилполігліколевий етер, алкілсульфонат, алкілсульфат, арилсульфонат, а також гідролізати яєчного білка. В якості диспергуючого засобу беруть наприклад, лігнін-сульфатний відпрацьований луг і метилцелюлозу.

Приготовлені форми можуть містити в якості засобів покращуючих адгезію карбоксиметилцелюлозу, природні і синтетичні порошкоподібні, зернисті або латексної форми полімери такі, як гуміарабік, полівініловий спирт, полівінілацетат, а також природні фосфоліпіди такі, як кефалін і лецитин, і синтетичні фосфоліпіди. Можуть бути також додані мінеральні і рослинні масла.

Можна застосовувати в якості барвників органічні пігменти наприклад, оксид заліза, оксид титану, ціан заліза синій і органічні фарбуючі речовини такі як алізарин-, азо- і металфталоцианінові барвники і мікроелементи такі, як солі заліза, марганцю, бору, міді, кобальту, молибдену і цинку.

Форми застосування містять, як правило, між 0,1 в 95 вагових процентів активної речовини, переважно між 0,5 і 90%.

Активна речовина, згідно винаходу, може міститись у приготовлених формах як самостійно, так і в сумішах з відомими фунгіцидами, бактерицидами, акарицидами, нематодіцидами або інсектицидами для того, наприклад, щоб, розширити спектр дії і запобігти стійкості до них. В багатьох випадках отримують при цьому, синергетичний ефект, тобто ефективність суміші більша ніж ефективність окремих компонентів.

В якості примішуваних речовин, мова йде наприклад, про такі сполуки: фунгіциди

алдіморф, ампропілфос, ампропілфос-калій, андопрім, анілазін, ацоназол, азоксістробін, беналаксил, беноданіл, беноміл, бензамакріл, бензамакріл-ізобутил, біапафос, бінапакріл, біфеніл, бітертанол, бластикдін-S, бромуконазол, бупірімат, бутіобат, полісульфід кальцію, карсіміцин, картафол, картан, карбендазім, карбоксин, карфон, хінометіонат (квінометіонат), хлорбендазол, хлорфеназол, хлороніб, хлоропкірин, хлороталоніл, хлосопінат, клоціпакон, куфраніб, кумоксаніл, купроконазол, купродиніл, купрофурам, дебакарб, дихлорофен, дихлобутразол, дихлофлуанід, дихломецин, дихлоран, діетофенкарб, дифеноконазол, диметирімом, диметоморф, диніконазол, диніконазол-M, динокап, дифеніламін, дипіритіон, диталіміфос, дитіанон, додеморф, додін, дразоксолон, епідерфос, епоксиконазол, етаконазол, етірімол, етрідіазол, фамоксадон, фенапаніл, фенарімом, фенбуконазол, фенфурам, фенітро-

пан, фенпіхлоніл, фенпропідин, фенпропіморф, фентінацетат, фентінідроксид, фебрам, феримзон, флуазинам, флуметофор, фторомід, флуквінканазол, флурпримідол, флусілазол, флусупамід, флутоланил, флутриафол, фолпет, фозетіл-алюміній, фозетіл-натрій, фталід, фуберідазол, фуралаксил, фураметрил, фуркарбоніл, фурконазол, фурконазол-цис, фурумециклокс, гуазатін, гексахлоробензол, гексиконазол, гумексазол, імізапіл, імібенконазол, іміноктадін, іміноктадінальбезилат, іміноктадініацетат, йодокарб, інконазол, іпробенфос (ІР), іпродіон, ірумаміцин, ізопротіолан, ізоваледін, казугаміцин, кресоксим-метил, сполуки міді такі як гідроксид міді, нафтенат міді, оксихлорид міді, сульфат міді, оксид міді, оксин міді і бордоська суміш, манкопер, манкозеб, манеб, мефе-рїмзоле, мепаніпурим, мепроніл, металаксил, метконазол, метасульфокарб, метфуроксам, метирам, метомеклам, метсульфовакс, мільдіуміцин, муклобутаніл, муклозолін, диметилдитіокарбамат нікелю, нітротал-ізопропіл, нуарімор, офураце, оксацикліс, оксомокарб, оксолінікацид, оксикарбоксим, оксифентин паклобутразол, пефуразоат, пенконазол, пенцикурон, фосдифен, пімаріцин, піпералін, попіоксін, попіоксорим, пробеназол, прохлораз, прокумідон, пропамокарб, пропанозим-натрій, пропіконазол, пропінеб, піразофос, пірфе-нокс, пірметаніл, піроквілон, піроксифур, квінконазол, квінтоцен (PCNB), сірка і сполуки сірки, тебу-коназол, теклофталат, текназен, тетциклакіс, тетраконазол, тіабендазол, тіціофен, тифлузамід, тіофанате-метил, тірам, тіоксимід, толхлофос-метил, толілфлуанід, триадімефон, триадіменол, триазбутил, триазоксид, трициклазол, тридеморф, трифлумізол, трифорін, трітїконазол, уніконазол, валідаміцин А, вінхлосалін, вінконазол, царіламід, цінеб, цирам, а також дагер D, ОК-8705, ОК-8801, α-(1,1-диметилетил)-β-(2-феноксїетил)-1Н-1,2,4-триазол-1-етанол, α-(2,4-дихлорфеніл)-β-фтор-β-пропіл-1 Н-1,2,4-триазол-1-етанол, α-(2,4-дихлорфеніл)-β-метокси-α-метил-1 Н-1,2,4-триазол-1-етанол, α-(5-метил-1,3-діоксан-5-іл)-β-[[4-(трифторметил)-феніл]-метиле]л-1 Н-1,2,4-триазол-1-етанол, (5RS, 6 RS)-6-гідрокси-2,2,7,7-тетраметил-5-(1Н-1,2,4-триазол-1-іл)-3-октанол, (Е)-α-(метоксиіміно)-N-метил-2-феноксї-фенїлацетамід, 1-ізопропіловий естер {2-метил-1-[[[1(4метилфеніл)етил]аміно]карбоніл]пропіл]-карбаїмової кислоти, α-(2,4-дихлорфеніл)-2-(1Н-1,2,4-триазол-1-іл)етанол-О-(фенілметил)-оксим, 1-(2-метил-1-нафталеніл)-1Н-пірол-2,5-діон, 1-(3,5-дихлорфеніл)-3-(2-пропеніл)-2,5-піролідіндіол, 1-[дїйодметил]-сульфоніл]-4-метил-бензол, 1-[[2-(2,4-дихлорфеніл)-1,3-діоксолан-2-іл]-метил]-1Н-їмідазол, 1-[[2-(2,4-хлорфеніл)-3-фенілоксораніл]-метил]-1Н-1,2,4-триазол, 1-[[1-(2,4-дихлорфенїл)метокси]фенїл]етенїл]-1 Н-їмідазол, 1-метил-5-ноніл-2-(фенїлметил)-3-

піропідінол, 2',6'-дїбром-2-метил-4'-трифторметїкси-4'-трифторметил-1,3-триазол-5-карбоксанїлід, 2,2-дихлор-N-[1-(4-хлорфенїл)етїл]-1-етїл-3-метїл-цїклопропанкарбоксамїд, 2,6-дихлор-5-(метїлтію)-4-пірїмїдїнілтріоксїанат, 2,2-дихлор-N-(4-трифторметїлбензїл)-бензамїд, 2,2-дихлор-N-[[4-(трифторметїл)фенїл]метїл]-бензамїд, 2-(2,3,3-трїйод-2-пропенїл)-2Н-тетразол, 2-[(1-метїлетїл)сульфонїл]-5-(трїхлорметїл)-1,3,4-тріадїазол, 2-[[6-деокси-4-О-(4-О-метїл-β-D-глікопіранозїл)-α-D-глікопіранозїл]-амїно]-4-метокси-1Н-піроло[2,3']пірїмїдїн-5-карбонїлтрїл, 2-амїнобутан, 2-бром-2-(бромметїл)-пентандїнтрїл, 2-хлор-N-(2,3-дїгїдро-1,1,3-трїметїл-1Н-їнден-4-їл)-3-пірїдїнкарбоксамїд, 2-хлор-N-(2,6-дїметїлфентї)-N-(їзотїюанатометїл)-ацетамїд, 2-фенїлфенол (OPP) 3,4-дихлор-1-[4-(дїфторметокси)-фенїл]-1 Н-пірол-2,5-діон, 3,4-дихлор-N-[цїан[(1-метїл-2-пропіл)окси]метїл]-бензамїд, 3-(1,1-дїметїлпропіл-1-оксо-1 Н-їнден-2-карбонїлтрїл, 3-[2-(4-хлорфенїл)-5-етокси-3-їзоксалїдїнїл]-пірїдїн, 4-хлор-2-цїан-N,N-дїметїл-5-(4-метїлфенїл)-1Н-їмідазол-1-сульфонамїд, 4-метїл-тетразоло[1,5-а]пентазолїн-5(4Н)-он, 8-(1,1-дїметїлетїл)-N-етїл-N-пропіл-1,4-діоксаспро[4,5]декан-2-метанамїно, 8-гіпроксїхінолінсульфат, 2-[(фенїламіно)-карбонїл]-гїдразїд 9Н-ксантен-9-карбонової кислоти, бїс-(1-метїлетїл)-3-метїл-4-[(3-метїлбензоїл)окси]-2,5-тіофендікарбоксїлат, цїс-1-(4-хлорфенїл)-2-(1Н-1,2,4-триазол-1-їл)-цїклогептанол, цїс-4-[3-[4-(1,1-дїметїлпропіл)-фенїл-2-метїлпропіл]-2,6-дїметїл-морфолїн-гідрохлорїд, етїл-[[4-хлорфенїл)-азо]-цїаноацетат, гідрогенкарбонат калїю, метантетратїол, -сїль натрію, метїл-1-(2,3-дїгїдро-2,2-дїметїл-1Н-їнден-1-їл)-1Н-їмідазол-5-карбоксїлат, метїл-N-(2,6-дїметїлфентї)-N-(5-130Ксазолткарбонш)-01-аланї'нат, N-(2,3-дїхлор-4-гідроксїфенїл)-1-метїл-цїклогексанкарбоксамїд N-(2,6-дїметїлфенїл)-2-метокси-N-(тетрагїдро-2-оксо-3-фуранїл)-ацетамїд, N-(2,6-дїметїлфенїл)-2-метокси-N-(тетрагїдро-2-оксо-3-тіенїл)-ацетамїд, N-(2-хлор-4-нїтрофенїл)-4-метїл-3-нїтробензолсульфонамїд, N-(4-цїклогексїлфенїл)-1,4,5,6-тетрагїдро-2-пірїмїдамін, N-(4-гексїлфенїл)-1,4,5,6-тетрагїдро-2-пірїмїдамін,

N -(5-хлор-2-метилфеніл)-2-метокси-N-(2-оксо-3-оксолідиніл)-ацетамід,

N -(6-метокси)-3-пиридиніл)-циклопропанкарбоксамід,

N -[2,2,2-трихлор-1-[(хлорацетат)-аміно]-етил]-бензамід,

N -[3-хлор-4,5-біс(2-пропілпокси)-феніл]-N'-метокси-метанімідамід,

N -форміл- N -гідрокси-DL-аланін, -сіль натрію, O,O-диетил-[2-(дипропіламіно)-2-оксоетил]-етилфосфорамідотіоат,

O-метил-S-феніл-фенілпропілфосфорамідотіоат, S-метил-1,2,3-бензотіадиазол-7-карботіоат, спіро[2H]-1 -бензопіран-2,1'(3'H)-ізобензофуран]-3'-он

Бактерициди

бромопол, дихлорофен, нітрапирин, диметил-дитіокарбамат нікелю, касугаміцин, октилінон, фуранкарбонова кислота, оксатетрациклін, пробензол, стрептоміцин, теклофталат, сульфат міді і інші сполуки, що містять мідь

Інсектициди (акарициди) нематодциди

абамектин, ацефат, акрінатрин, аланіфарб, алдикарб, алфаметрин, амітраз, афермектин, AZ 60541, азадирахтин, азинфос А, азинфос М, азоциклотін, *Bacillus thuringiensis*, 4-бром-2-(4-хлорфеніл)-1-(етоксиметил)-5-(трифторметил)-1H-пірол-3-карбонітрил, бендіокарб, бенферакарб, бенсультаб, бетацифлутрин, біфентріл, BPMC, брофенпрокс, бромфос А, буфенкарб, бупрофезин, бутіокарбоксин, бутілпуридабен, кадусафос, карбаріл, карбофуран, карбофенотіон, карбосульфат, картап хлоетоккарб, хлоретоксифос, хлорфенапір, хлорфенфінфос, хлорфлуацирон, хлормефос, N-[(6-хлор-3-пиридиніл)-метил]-N'-ціано-N-метилетанімідамід, хлорпірифос, хлорпірифос М, цис-резметрин, клоцитрин, клофентизин, ціанофос, циклопротрин, цифлутрин, цихалотрин, цихексатин, циперметрин, циромазин, дельтаметрин, деметон М, деметон S, деметон-S-метил, діафентіурон, діазинон, дихлофентіон, дихлофос, дикліфос, дихротофос, диетіон, дифлубензурон, диметоат, диметилфінфос, диоксатіон, дисульфотон, едіфенфос, емабектин, есфенвалерат, етофенкарб'етіон, етофенпрокс, етопрофос, фенаміфос, феназаквін, фенбутатіноксид, фентротіон, фенобукарб, фенотіокарб, феноксикарб, фенпропатрин, фенпурад, фенпуроксимат, фентіон, фенвалерат, фіпроніл, флуазінам, флуазурон, флуциклоксирон, флуцитринат, флуфеноксирон, флуфенпрокс, HCH, гептефос, гексафлумурон, гекситазокс, Імідаклопрід, іпробенфос, ізацфос, ізофенфос, ізопрокарб, ізоксатіон, іфермектин, ламда-цугалотрин, луфенурол, малатіон, мекарбам, мерфінфос, месульфенфос, металдегід, метакріфос, метамідофос, метідатіон, метіокарб, метоміл, метопкарб, мельбемектин, монокротофос, моксидектин, налед, NC 184, нітенпурам, ометоат, оксаміл, оксидеметон М, оксидепрофос, паратіон А, паратіон М, перметрин, фентоат, форат, фосалон, фосмет, фосфамідон, фоксім, пірімкарб, пірімфос М, пірімфосА, профенофос, промекарб, пропафос, пропоксір, протіофос, протоат, піметрозин, пірахлофос, пірадафентіон, піресметрин, піретрум, пірдабен, пірімідифен, пірпроксифен, квінальфос, са-

літіон, себуфос, слафілуофен, сульфотеп, сульпрофос, тебуфенозід, тебуфенпірад, тебупірімфос, тефлубензурон, тефлутрин, темефос, тербам, тербуфос, тетрахлорфінфос, тіафенокс, тіодикарб, тіофанокс, тіометон, тіоназін, турінглізін, трапометрин, триаратен, триазофос, триазофос, триазурон, трихлорфон, трифлумірон, триметакарб, фамідотіон, ХМС, ксилілкарб, зетаметрин

Також можливе змішування з іншими відомими активних речовин, можливо такими, як гербіциди або добрива і регулятори росту

Активні речовини можуть застосовуватись в їх товарних формах або у вигляді приготівлених з цього форм застосування такі, які готові до використання, це розчини, суспензії, порошки для розпилення, пасти, розчинні порошки, порошок і гранули. Застосування проводять загальновідомими способами, наприклад поливання, розбріскування, розсипання, розпилення, обмашування та інші. Також можливо, що активні речовини вносять у форми приготівленого із дуже малих об'ємів холодного або гарячого туману, або що

форми активної речовини, готові для використання, або саму активну речовину вносять в ґрунт, їх також можливо використовувати для обробки насіння рослин

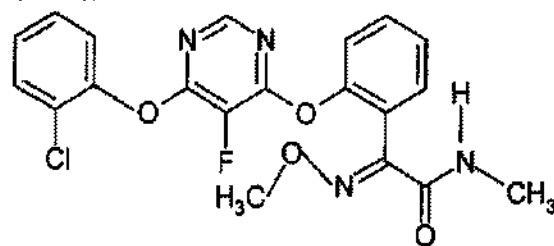
При обробці частин рослин можна варіювати концентраціями активної речовини приготівленої в формах придатних для застосування в великих межах вони лежать, як правило, між 1 і 0,0001ваг %, переважно між 0,5 і 0,001ваг %

При обробці насіння використовують, як правило, від 0,001г до 50г активної речовини на кожен кілограм насіння, переважно від 0,01г до 10г

При обробці ґрунту використовують концентрації активних речовин від 0,00001 до 0,1ваг %, переважно від 0,0001 до 0,02ваг % на місце дії

Приклади одержання

Приклад 1



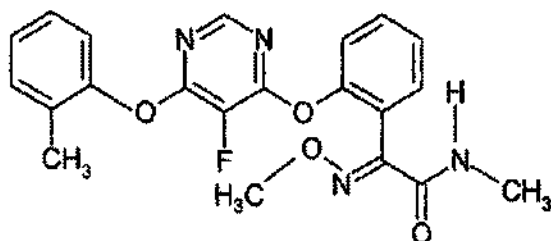
спосіб а)

До суміші, яка складається із 2г (0,0096моль) 2-(2-гідрокси-феніл)-2-метоксиміно-N-метилацетаміду і 2,3г (0,0095моль) 4-(2-хлорфенокси)5,6-дифторпіримідину в диметилформаміді додають при охолодженні 0,4г (0,01моль) 60%-ного гідриду натрію і перемішують протягом 12 годин при 25°C. Виливають реакційну суміш у воду, екстрагують дихлорметаном, висушують органічну фазу над сульфатом натрію і відганяють розчинник у вакуумі. Проводять хроматографію залишку сумішшю із рівних об'ємів етилового естера оцтової кислоти і циклогексану на силікагелі. Одержують 2,1г (48,3% від теорії) 2-(2-(6-(2-хлорфенокси)-5-фторпіримідин-4-ілокси)-феніл)-2-метоксиміно-N-метилацетаміду

¹H-ЯМР-спектр (CDCl₃/TMS) δ = 2,88/2,90 (3H), 3,82 (3H), 6,68 (1H), 7,25-7,54 (8H), 8,05

(1H)м ч

Приклад 2



спосіб б)

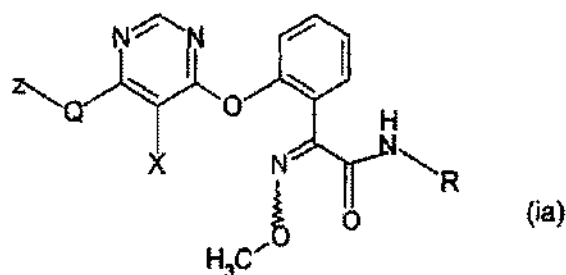
До суміші, яка складається із 2г (0,0062моль) 2-(2-(5,6-дифторпіримідин-4-ілокси)-феніл)-2-метоксиімїно-N-метилацетамїду і 0,67г (0,0062моль) 2-метилфенолу в 2мл диметилформамїду додають при охолодженї 0,25г

(0,0062моль) 60%-ного гїдрїду натрію і перемїшують протягом 12 годин при 25°C. Виливають реакційну сумїш у воду, екстрагують етиловим естером оцтової кислоти, висушують органїчну фазу над сульфатом натрію і відганяють розчинник у вакуумї. Одержують 1,5г (58,9% від теорїї) 2-(2-(5-фтор-6-о-толтокси(рїмщїн-4-токси)-фенїл)-2-метоксиімїно-N-метилацетамїду

¹H-ЯМР-спектр (COCl₂/ЯМ8) δ = 2,21 (3H), 2,89/2,90 (3H), 3,84 (3H), 6,7 (1H,в), 7,06-7,53 (8H), 8,06 (1H) м ч

Аналогїчно прикладам 1-2, а також згїдно з даними наведеними в загальному описї методу одержання, були одержанї сполуки формулї (Ia), якї наведенї нижче в таблицї 1

Таблиця 1



(Ia)

№ прикладу	R	Q	X	R	Темп пл (°C)	ЯМР	Log P
3	фенїл	O	F	-CH ₃	107	3,85	2,77
4	2-ціанфенїл	O	F	-CH ₃	128-130	3,85	2,8
5	2-метоксифенїл	O	F	-CH ₃		3,83	2,72
2	2-метилфенїл	O	F	-CH ₃		3,84	3,04
6	4-хлорфенїл	O	F	-CH ₃		3,85	3,22
7	2-ацетилфенїл	O	F	-CH ₃		3,85	2,51
8	2-алїлоксифенїл	O	F	-CH ₃		3,82	3,11
9	2-пропіонїлоксифенїл	O	F	-CH ₃		3,85	2,83
10	2-хлорфенїл	O	F	-H		3,87	2,79
11	2-бромфенїл	O	F	-CH ₃		3,83	3,08
12	2-фторфенїл	O	F	-CH ₃		3,82	2,85
13	2,4-дїбромфенїл	O	F	-CH ₃		3,83	3,76
14	2,3-дїхлорфенїл	O	F	-CH ₃		3,83	3,45
15	2,4-дїхлорфенїл	O	F	-CH ₃		3,83	3,61
16	2,5-дїхлорфенїл	O	F	-CH ₃		3,83	3,53
17	2,6-дїхлорфенїл	O	F	-CH ₃		3,79	3,35
18	2,3-дїметилфенїл	O	F	-CH ₃		3,77	3,30
19	2,4-дїметилфенїл	O	F	-CH ₃		3,84	3,39
20	2,5-дїметилфенїл	O	F	-CH ₃		3,76	3,52
21	2, 6-д и метил фенїл	O	F	-CH ₃		3,82	3,29
22	2-хлор-4-метилфенїл	O	F	-CH ₃		3,82	3,41
23	2-хлор-5-метилфенїл	O	F	-CH ₃		3,82	3,37
24	3-хлор-2-метилфенїл	O	F	-CH ₃		3,84	3,50
25	4-хлор-2-метилфенїл	O	F	-CH ₃			
26	2-бром-4-хлорфенїл	O	F	-CH ₃		3,83	3,65
27	4-бром-2-хлорфенїл	O	F	-CH ₃		3,82	3,70
28	фенїл	S	F	-CH ₃		3,81	3,07

*) ¹H-ЯМР-спектри знімали в дейтерохлороформї (CDCl₃) або в гексадейтеродиметилсульфоксїдї (DMSO-d₆) з тетраметилсиланом (TMS) в якостї внутрішнього стандарту. Хїмічні зсуви δ-значень вказанї в мільйонних частках.

**) Визначення значення log P було здїйснено згїдно з директивою ЕЕС 79/831 Annex V A8 за допомогою HPLC (рїдкий хроматограф фірми Хїюлетт-Паккард) градієнтним методом (ацетонїтрил/0,1% водна фосфорна кислота).

CN(C(=O)C1=CC=C(O)C=C1)N=COFc1nc(F)c(Oc2ccccc2)n1CN(C)C(=O)C1=CN(OC(F)Fc2ncnc2Oc3ccccc13)CFc1nc(F)c(F)n1

Приклади застосування

Для випробування на захисну ефективність

обприскують молоді рослини препаратом активної речовини вказаного складу

Після висихання осаду на обприсканих рослинах інюкують (заражають) рослини водними суспензіями спор *Plasmopara viticola* і залишають на один день в інкубаційній кабіні при 20°C і 100% відносній вологості повітря. Потім рослини стояли 5 днів в теплиці при 21°C і близько 90% вологості повітря. Потім рослини обприскали і поставили на один день в інкубаційну кабінку

Через 6 днів після інюкації (зараження)

Приклад В

Sphaerotheca тест (огірки) / захисний

розчинник

емульгатор

47 вагових частин ацетону

3 вагових частини алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до бажаних концентрацій

Для випробування на захисну ефективність обприскують молоді рослини препаратом активної речовини вказаного складу. Після висихання осаду на обприсканих рослинах інюкують (заражають) рослини водними суспензіями спор *Sphaerotheca fuliginea*. Рослини потім помістили в теплиці при близько 23°C і відносній вологості близько 70%

Приклад С

Venturia-тест (яблука) / захисний

розчинник

емульгатор

47 вагових частин ацетону

3 вагових частини алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до бажаних концентрацій

Для випробування на захисну ефективність обприскують молоді рослини препаратом активної речовини вказаного складу. Після висихання осаду на обприсканих рослинах інюкують (заражають) рослини водними конідіесуспензіями збудників яблучної парші і залишають на один день в інкубаційній кабіні при близько 20°C і 100% відносній вологості

Приклад D

Erysiphe-тест (ячмінь) / захисний

розчинник

емульгатор

10 вагових частин N-метилпіролідону

0,6 вагових частини алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до бажаних концентрацій

Для випробування на захисну ефективність обприскують молоді рослини препаратом активної речовини вказаного складу

Після висушування осаду на обприсканих рослинах рослини запилюють спорами *Erysiphe graminis* f. sp. hordei

здійснюють оцінку ефективності. При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження

При цьому тесті показано, що ступінь активності наприклад сполук таких прикладів одержання (1), (2), (3), (12), (13), (14), (15), (16), (17), (18), (20), (22), (23), (24), (26), (27) і (28) складала 91% або більше в порівненні до проведеного контролю при кількості витрат активної речовини 100г/га

Через 10 днів після інюкації (зараження) здійснюють оцінку ефективності. При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження

При цьому тесті показано, що ступінь активності наприклад сполук таких прикладів одержання (1), (2), (3), (6), (7), (9), (12), (13), (14), (15), (17), (18), (20), (21), (22), (23), (24), (26), (27) і (28) складала 91% або більше в порівненні до проведеного контролю при кількості витрат активної речовини 100г/га

Рослини потім помістили в теплицю при близько 21°C і відносній вологості близько 90%

Через 12 днів після інюкації (зараження) здійснюють оцінку ефективності. При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження

При цьому тесті показано, що ступінь активності наприклад сполук таких прикладів одержання (2), (3), (6), (8), (9), (12), (14), (17), (18), (21) і (28) складала 96% або більше в порівненні до проведеного контролю при кількості витрат активної речовини 10 г/га

Рослини потім помістили в теплицю при близько 20°C і відносній вологості близько 80% з метою сприяння розвитку мучнистої роси

Через 7 днів після інюкації (зараження) здійснюють оцінку ефективності. При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження

При цьому тесті показано, що ступінь активності наприклад сполук таких прикладів одержання (2), (3) і (8) складала 100% або більше в

порівнені до проведеного контролю при кількості

витрат активної речовини 250г/га

Приклад Е

Erysiphe-тест (ячмінь) / лікувальний

розчинник

емульгатор

10 вагових частин N-метилпіролідону

0,6 вагових частини алкіларипполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до бажаних концентрацій

Для випробування на лікувальну ефективність запилюють молоді рослини спорами *Erysiphe graminis f. sp. hordei*. Через 48 годин після інкубації (зараження) обприскують рослини препаратом активної речовини вказаного складу

Рослини потім помістили в теплицю при близько 20°C і відносній вологості близько 80% з

метою сприяння розвитку мучнистої роси

Через 7 днів після інкубації (зараження) здійснюють оцінку ефективності. При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження

При цьому тесті показано, що ступінь активності наведених в прикладах (2), (3), (6), (9) і (10) речовин згідно винаходу становила 90% або більше при кількості витрат активної речовини 250г/га

Приклад F

Rhynchospora тест (рис) / захисний

розчинник

емульгатор

12,5 вагових частин ацетону

0,3 вагових частини алкіларипполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до бажаних концентрацій

Для випробування на захисну ефективність обприскують молоді рослини препаратом активної речовини вказаного складу до появи крапель і через один день після висихання осаду на обприсканих рослинах інкубують (заражають) рослини водними суспензіями спор *Rhynchospora oryzae*. Потім стояли рослини в теплиці при 100% вологості повітря і близько 25°C

Через 4 дні після інкубації (зараження) здійснюють оцінку ефективності

При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження

При цьому тесті показано, що ступінь активності наприклад сполук таких прикладів одержання (1), (2), (3), (4), (8), (9), (10), (20), (21), (22) і (24) складала 80% або більше в порівненні до проведеного контролю при кількості витрат активної речовини 750г/га

Риссипа-тест (пшениця) / захисний

розчинник

емульгатор

25 вагових частин N,N- диметилацетаміду

0,6 вагових частини алкіларипполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до бажаних концентрацій

Для випробування на захисну ефективність обприскують молоді рослини препаратом активної речовини вказаного складу. Після висихання осаду на обприсканих рослинах інкубують (заражають) рослини кондієсуспензіями *Rhynchospora recondita*. Рослини знаходились 48 годин в інкубаційній кабінеті при 20°C і 100% відносній вологості повітря

Рослини потім помістили в теплицю при близько 20°C і відносній вологості повітря близько 80% з метою сприяння розвитку

Через 10 днів після інкубації (зараження) здійснюють оцінку ефективності. При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження

При цьому тесті показано, що ступінь активності наведених в прикладах (1), (2), (5), (12), (13), (14), (15), (16), (24) і (26) речовин згідно винаходу становила 90% або більше при кількості витрат активної речовини 250 г/га

Приклад H

Fusarium nivale (var. nivale)-Тест (пшениця) / захисний

розчинник

емульгатор

25 вагових частин N,N- диметилацетаміду

0,6 вагових частини алкіларипполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до

бажаних концентрацій

Для випробування на захисну ефективність обприскують молоді рослини препаратом активної речовини вказаного складу. Після висихання

осаду на обприсканих рослинах инокулюють (заражають) рослини конідіесуспензіями *Fusarium nivale* (var. *nivale*)

Рослини потім помістили в теплицю під світлопроникаючий інкубаційний ковпак при температурі близько 15°C і відносній вологості повітря близько 100%

Через 4 дні після инокуляції (зараження) здійснюють оцінку ефективності. При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження.

Приклад І

Fyrenophora teres (пшениця) / захисний

розчинник

емульгатор

25 вагових частин N,N- диметилацетаміду

0,6 вагових частини алкілариполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до бажаних концентрацій.

Для випробування на захисну ефективність обприскують молоді рослини препаратом активної речовини вказаного складу. Після висихання осаду на обприсканих рослинах инокулюють (заражають) рослини конідіесуспензіями *Fyrenophora teres*. Рослини знаходились 48 годин в інкубаційній кабіні при 20°C і 100% відносній вологості повітря.

Приклад К

Phytophthora-тест (помідори) / захисний

розчинник

емульгатор

47 вагових частин ацетону

3 вагових частини алкілариполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до бажаних концентрацій.

Для випробування на захисну ефективність обприскують молоді рослини препаратом активної речовини вказаного складу. Після висихання осаду на обприсканих рослинах инокулюють рослини водними суспензіями спор *Phytophthora infestans*. Рослини потім знаходяться в інкубаційній кабіні при близько 20°C і 100% відносній вологості повітря.

При цьому тесті показано, що ступінь активності наведених в прикладах (1), (2), (13), (14), (15), (16), (17), (20), (21), (22), (24) і (26) речовин згідно винаходу становила 90% або більше при кількості витрат активної речовини 250г/га.

Рослини потім помістили в теплицю при близько 20°C і відносній вологості близько 80%.

Через 7 днів після инокуляції (зараження) здійснюють оцінку ефективності. При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження.

При цьому тесті показано, що ступінь активності наведених в прикладах (17) і (28) речовин згідно винаходу становила 90% або більше при кількості витрат активної речовини г/га.

Через 3 дні після инокуляції (зараження) здійснюють оцінку ефективності. При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження.

При цьому тесті показано, що ступінь активності наведених в прикладах (8), (9) і (10) речовин згідно винаходу становила 96% або більше при кількості витрат активної речовини г/га.