



УКРАЇНА

(19) UA (11) 80304 (13) C2
(51) МПК (2006)
A01N 43/90
C07D 487/04 (2007.01)

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ

ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) ЗАМІЩЕНІ 6-(2-ГАЛОГЕНФЕНІЛ)ТРИАЗОЛОПІРИМІДИНИ

1

2

(21) а200505358

(22) 04.11.2003

(24) 10.09.2007

(86) РСТ/ЕР2003/012276, 04.11.2003

(31) 02024808.4

(32) 07.11.2002

(33) ЕР

(46) 10.09.2007, Бюл. № 14, 2007 р.

(72) Тормо І Бласко, ES, Блеттнер Карстен, DE, Мюллер Бернд, DE, Геве Маркус, DE, Граммелос Вассіліос, GR, Гроте Томас, DE, Гупсер Андреас, DE, Райнхаймер Йоахим, DE, Шефер Петер, DE, Шівек Франк, DE, Швюглер Аня, DE, Аммерманн Еберхард, DE, Штралманн Зігфрід, DE, Шюфль Ульріх, DE, Штраль Райнхард, DE

(73) БАСФ АКЦІЄНГЕЗЕЛЬШАФТ, DE

(56) WO 98 46608 A, 22.10.1998

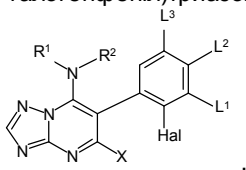
FR 2 765 875 A, 15.01.1999

EP 0 550 113 A, 07.07.1993

FR 2 784 991 A, 28.04.2000

US 5 986 135 A, 16.11.1999

(57) 1. Заміщені 6-(2-галогенфеніл)триазолопиримідини формули I



у якій

Hal означає галоген,

L¹, L³ незалежно означають водень, галоген або C₁-C₄-алкіл,

L² означає водень, галоген, C₁-C₄-галоалкіл або NH₂, NHR^b або N(R^b)₂,

R^b означає C₁-C₈-алкіл, C₃-C₁₀-алкеніл, C₃-C₁₀-алкініл, C₁-C₆-галоалкіл, C₃-C₆-галоалкеніл, C₃-C₆-

галоалкініл, C₁-C₈-алкокси-C₁-C₈-алкіл, C₁-C₈-алкілтіо-C₁-C₈-алкіл, C₃-C₁₀-циклоалкіл або C(=O)-A, де

A означає водень, гідрокси, C₁-C₈-алкіл, C₁-C₈-алкокси, C₁-C₆-галогеналкокси, C₁-C₈-алкіламіно або ді-(C₁-C₈-алкіл)аміно, причому щонайменше один з L¹, L² та L³ не є воднем,

X означає галоген, ціано, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галоалкокси або C₃-C₈-алкенілокси, R¹ означає C₁-C₁₀-алкіл, C₂-C₁₀-алкеніл, C₂-C₁₀-алкініл або C₄-C₁₀-алкадієніл, C₂-C₁₀-галоалкеніл, де R¹ може бути незаміщеним або може нести від однієї до трьох груп R^a,

R^a означає ціано, нітро, гідроксил, C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкілтіо, C₁-C₆-алкіламіно, ді-C₁-C₆-алкіламіно, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-алкенілокси, C₂-C₆-алкініл, C₃-C₆-алкінілокси або C₁-C₄-алкілендіокси,

R² означає водень.

2. Сполука формули I за п. 1, у якій

R¹ означає лінійний або розгалужений C₂-C₆-алкеніл, C₁-C₆-алкіл.

3. Сполука формули I за п. 1 або 2, у якій

X означає галоген.

4. Сполука формули I за будь-яким з пп. 1-3, у якій 6-(2-галогенфенільна) група являє собою один з наступних залишків:

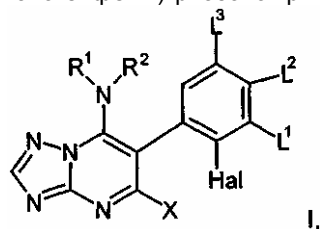
2,3,5-трифторфеніл, 2-F,4-CF₃-феніл, 2-F,5-CH₃-феніл, 2-Cl,4-F-феніл, 2-F,4-Cl-феніл, 2-F,4-Br-феніл, 2-Cl,4-Br-феніл, 2,3-дифторфеніл, 2,4-дифторфеніл, 2,4,5-трифторфеніл, 2,3,4-трифторфеніл, 2-F,4-NHC(O)CH₃-феніл, 2-Br,3,5-дифторфеніл, 2-F,4-NO₂-феніл та 2-Cl,4-NO₂-феніл.

(13) C2

(11) 80304

(19) UA

Винахід відноситься до заміщених 6-(2-галогенфеніл)триазолопіримідинів формули I



у якій

R¹ означає C₁-C₁₀-алкіл, C₂-C₁₀-алкеніл, C₂-C₁₀-алкініл або C₄-C₁₀-алкадієніл, C₁-C₁₀-галоалкіл, C₂-C₁₀-галоалкеніл, C₃-C₁₀-циклоалкіл, феніл, нафтил або

5- або 6-членний насичений, ненасичений або ароматичний гетероцикл, що містить від одного до чотирьох атомів азоту або від одного до трьох атомів азоту та один атом сірки або кисню,

де залишки R¹ та R² можуть бути незаміщеними або частково або повністю галогенованими або можуть мати від однієї до трьох груп R^a,

R^a означає ціано, нітро, гідроксил, C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкілтіо, C₁-C₆-алкіламіно, ді-C₁-C₆-алкіламіно, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-алкенілокси, C₂-C₆-алкініл, C₃-C₆-алкінілокси або C₁-C₄-алкілендіокси;

R² означає водень або групу, зазначену для R¹; або

R¹ та R² разом з розташованим між ними атомом азоту являють насичений або частково ненасичений 5- або 6-членний гетероцикл, що містить від одного до чотирьох атомів азоту або від одного до трьох атомів азоту та один атом сірки або кисню, причому кільце може бути заміщене від одного до трьох разів залишками R^a;

Hal означає галоген;

L¹, L³ незалежно означають водень, галоген або C₁-C₄-алкіл;

L² означає водень, галоген, C₁-C₄-галоалкіл або NH₂, NHR^b або N(R^b)₂,

R^b означає C₁-C₈-алкіл, C₃-C₁₀-алкеніл, C₃-C₁₀-алкініл, C₁-C₆-галоалкіл, C₃-C₆-галоалкеніл, C₃-C₆-галоалкініл, C₁-C₈-алкокси-C₁-C₈-алкіл, C₁-C₈-алкілтіо-C₁-C₈-алкіл, C₃-C₁₀-циклоалкіл або C(=O)-A, де

A означає водень, гідрокси, C₁-C₈-алкіл, C₁-C₈-алкокси, C₁-C₆-галогеналкокси, C₁-C₈-алкіламіно або ди-(C₁-C₈-алкіл)аміно;

причому, щонайменше, один з L¹, L² та L³ не є воднем;

X означає галоген, ціано, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галоалкокси або C₃-C₈-алкенілокси.

Крім того, винахід відноситься до способів їх одержання, композицій, що їх містять, а також до їх використання для боротьби з фітопатогенними грибами.

6-феніл-7-амінотриазолопіримідини в основному відомі [з патентів US 4,567,262 та EP-A 550 113].

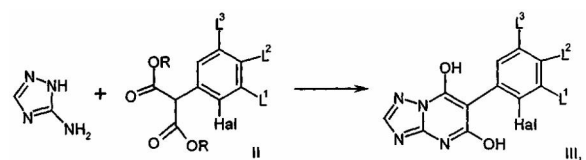
Триазолопіримідини з трифторфенільною групою в 6-положенні [описані в WO 98/46607 та EP-A 945 453]. [з EP-A 834 513] відомі різні 6-пентафторфенілтриазолопіримідини.

Вважають, що сполуки, які описані в документах, що згадані вище, активні проти різних фітопатогенних грибків.

Метою даного винаходу є одержання сполук, що мають поліпшену фунгіцидну активність.

Було встановлено, що зазначена мета досягається сполуками, які визначені на початку опису. Крім того, був розроблений спосіб їх одержання, композиції, що їх містять, та способи боротьби з фітопатогенними грибами з використанням сполук формули I.

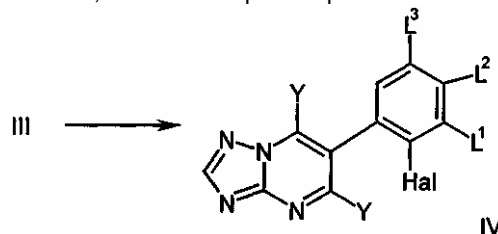
Сполуки формули I відрізняються від сполук, відомих з найбільш близького рівня техніки [EP-A 945 453 та EP-A 834 513] 6-(2-галогенфенільною) групою, що додатково заміщена в 3-, 4- і/або 5-положенні. Сполуки формули I можуть бути одержані в умовах, що аналогічні умовам, відомим з [EP-A 550 113]. Бажано сполуки формули I, що згадані вище, одержувати взаємодією 5-амінотриазолу зі складним ефіром 2-(2-галогенфеніл)заміщеної малонової кислоти формули II



у якій

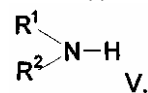
R означає алкіл, краще C₁-C₆-алкіл, зокрема, метил або етил, у лужних умовах, краще, використовуючи висококиплячі третинні аміни, такі як, наприклад, три-н-бутиламін, як описано, [наприклад, в EP-A 770 615], з одержанням сполуки формули III.

Одержаний 5,7-дигідрокси-6-фенілтриазолопіримідин формули III, у якій L¹-L³ мають значення, зазначені для формули I, потім обробляють галогенуючим агентом, краще бромуючим або хлоруючим агентом, таким як оксидбромід фосфору або оксихлорид фосфору, нерозбавленим або в присутності розчинника, з одержанням сполуки формули IV, у якій В означає галоген, такий як хлор або бром.



Реакцію належним чином проводять при температурі в інтервалі від 0°C до 150°C, краще, при реакційній температурі від 80°C до 125°C, як описано, [наприклад, в EP-A 770 615].

Дигалотриазолопіримідин IV надалі вводять у взаємодію з аміном формули V



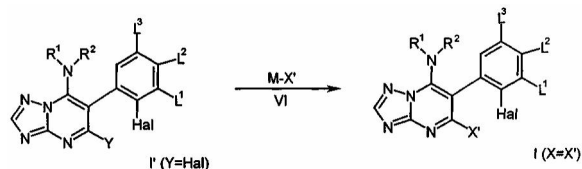
у якій R^1 та R^2 мають значення, зазначені для формули I, з одержанням сполук формули I, у якій X означає галоген.

Реакцію між 5,7-дигалосполукою формули IV та аміном формули V можна проводити в умовах, [відомих з WO 98/46608]. Реакцію бажано проводити у присутності розчинника. Придатні розчинники включають прості ефіри, такі як діоксан, діетиловий ефір та, особливо, тетрагідрофуран, галогеновані вуглеводні, такі як дихлорметан, і ароматичні вуглеводні, наприклад, толуол.

Реакцію звичайно проводять при температурі в інтервалі від 0°C до 70°C , краще, при реакційній температурі від 10°C до 35°C .

Також краще реакцію проводити в присутності основи. Придатні основи включають третинні аміни, такі як триетиламін, і неорганічні основи, такі як карбонат калію або карбонат натрію. Альтернативно, як основу можна використовувати надлишок сполуки формули V.

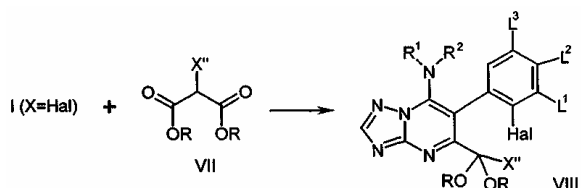
Сполуки формули I, у якій X означає ціано, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси або C_3 - C_8 -алкенілокси можуть бути одержані взаємодією сполук формули I', у якій Y означає галоген, краще хлор, зі сполуками формули VI, які, залежно від значень X' , які повинні бути введені для одержання сполук формули I, є неорганічною ціаносіллю, алкоксилатом, галоалкоксилатом або алкенілоксилатом, відповідно, бажано в присутності розчинника. Катіон M у формулі VI має незначний вплив; з практичних та економічних міркувань перевага звичайно віддається солям амонію, тетраалкіламонію або лужних і лужноземельних металів.



Реакцію звичайно проводять при температурі в інтервалі від 0°C до 120°C , краще, при реакційній температурі від 10°C до 40°C [порівн.: J. Heterocycl. Chem., том 12, стор. 861-863 (1975)].

Придатні розчинники включають прості ефіри, такі як діоксан, діетиловий ефір та, особливо, тетрагідрофуран, галогеновані вуглеводні, такі як дихлорметан, і ароматичні вуглеводні, наприклад, толуол.

Сполуки формули I, у якій X означає C_1 - C_6 -алкіл, можуть бути одержані взаємодією сполук формули I, у якій X означає галоген, краще хлор, зі складними ефірами маленової кислоти формули VII, у якій X'' означає H або C_1 - C_5 -алкіл, а R означає C_1 - C_4 -алкіл, з одержанням сполук формули VIII і наступним декарбоксилюванням в умовах, [що описані у US 5,994,360].



Таким чином, винахід відноситься до нових проміжних сполук формул II, III та IV.

Сполуки формули II бажано одержувати взаємодією відповідних заміщених бромбензолів з діалкілмалонатами натрію в присутності солей міді(I) [порівн.: Chemistry Letters, стор.367-370,1981; EP-A 10 02 788].

Сполуки формули II також можуть бути одержані взаємодією алкіл-2-(2-галогенфеніл)ацетату з діалкілкарбонатом у присутності сильної основи, краще, етоксиду натрію та гідриду натрію [порівн.: Heterocycles, стор. 1031-1047, 1996].

Заміщені фенілацетати, які є вихідними сполуками для сполук формули II, відомі та випускаються серійно і/або вони можуть бути одержані відомими способами.

Реакційні суміші обробляють звичайними способами, наприклад, змішуванням з водою, розділенням фаз та, при необхідності, хроматографічним очищенням сирих продуктів. Деякі з кінцевих продуктів одержуються у формі безбарвних або злегка коричнюватих в'язких масел, які очищують або звільняють від летучих компонентів при зниженому тиску та помірно підвищених температурах. Якщо кінцеві продукти одержуються у вигляді твердих речовин, очищення можна також проводити перекристалізацією або дигеруванням.

Якщо індивідуальні сполуки I не можуть бути одержані способами, що описані вище, їх можна одержати шляхом одержання похідних інших сполук формули I.

У визначенні символів, що наведені у формулах вище, використані загальні терміни, які звичайно являють наступні замісники:

Галоген: фтор, хлор, бром та йод;

C_1 - C_{10} -алкіл: насичені вуглеводневі залишки з лінійним або розгалуженим ланцюгом, що мають від 1 до 10, особливо, від 1 до 6 атомів вуглецю, наприклад, C_1 - C_4 -алкіл, що зазначений вище, або пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропіл, 1-етилпропіл, гексил, 1,1-диметилпропіл, 1,2-диметилпропіл, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-етилбутил, 2-етилбутил, 1,1,2-триметилпропіл, 1,2,2-триметилпропіл, 1-етил-1-метилпропіл та 1-етил-2-метилпропіл;

C_2 - C_{10} -алкеніл: ненасичені вуглеводневі залишки з лінійним або розгалуженим ланцюгом, що мають від 2 до 10, особливо, від 2 до 6 атомів вуглецю та подвійний зв'язок у будь-якому положенні, наприклад, етеніл, 1-пропеніл, 2-пропеніл, 1-метилетеніл, 1-бутеніл, 2-бутеніл, 3-бутеніл, 1-

метил-1-пропеніл, 2-метил-1-пропеніл, 1-метил-2-пропеніл та 2-метил-2-пропеніл;

C₂-C₁₀-алкіліл: вуглеводневі залишки з лінійним або розгалуженим ланцюгом, що мають від 2 до 10, особливо, від 2 до 4 атомів вуглецю та потрійний зв'язок у будь-якому положенні, наприклад, етиніл, 1-пропініл, 2-пропініл, 1-бутиніл, 2-бутиніл, 3-бутиніл та 1-метил-2-пропініл;

C₃-C₁₀-циклоалкіл: моно- або біциклічні циклоалкільні групи, що мають від 3 до 10 атомів вуглецю, моноциклічні групи краще мають від 3 до 8, особливо, від 3 до 6 членів кільця, біциклічні групи краще мають від 8 до 10 членів кільця.

5- або 6-членний насичений або частково ненасичений гетероцикл, що містить від одного до чотирьох атомів азоту або від одного до трьох атомів азоту та один атом сірки або кисню, краще один атом кисню, наприклад, насичені гетероцикли, такі як 1-піримідиніл, 2-піримідиніл, морфолін-4-іл, тіоморфолін-4-іл; або частково ненасичені гетероцикли, що містять один C=C або один N=O подвійний зв'язок, такі як 3,6-дигідро-2H-піридин-1-іл, або 2,5-дигідропірол-4-іл;

5-членний ароматичний гетероцикл, що містить від одного до чотирьох атомів азоту або від одного до трьох атомів азоту та один атом сірки або кисню: 5-членні гетероарильні групи, які, крім атомів вуглецю, можуть містити від одного до чотирьох атомів азоту або від одного до трьох атомів азоту та один атом сірки або кисню як члени кільця, наприклад, 2-фурил, 3-фурил, 2-тієніл, 3-тієніл, 2-піроліл, 3-піроліл, 3-ізоксазоліл, 4-ізоксазоліл, 5-ізоксазоліл, 3-ізотіазоліл, 4-ізотіазоліл, 5-ізотіазоліл, 3-піразоліл, 4-піразоліл, 5-піразоліл, 2-оксазоліл, 4-оксазоліл, 5-оксазоліл, 2-тіазоліл, 4-тіазоліл, 5-тіазоліл, 2-імідазоліл, 4-імідазоліл, 1,2,4-оксадіазол-3-іл, 1,2,4-оксадіазол-5-іл, 1,2,4-тіадіазол-3-іл, 1,2,4-тіадіазол-6-іл, 1,2,4-тріазол-3-іл, 1,3,4-оксадіазол-2-іл, 1,3,4-тіадіазол-2-іл та 1,3,4-тріазол-2-іл;

6-членний ароматичний гетероцикл, що містить від одного до чотирьох атомів азоту: 6-членні гетероарильні групи, які, крім атомів вуглецю, можуть містити від одного до трьох або від одного до чотирьох атомів азоту як члени кільця, наприклад, 2-піридиніл, 3-піридиніл, 4-піридиніл, 3-піридазиніл, 4-піридазиніл, 2-піримідиніл, 4-піримідиніл, 5-піримідиніл, 2-піразиніл, 1,3,5-тріазин-2-іл та 1,2,4-тріазин-3-іл, краще піридиніл, піримідиніл, піразиніл або тієніл.

Що стосується їх використання, яке передбачається, то перевага віддається триазолопіримідинам формули I, що мають наступні замісники, причому в кожному випадку кращими є окремі замісники або їх комбінації:

Кращим циклоалкільним залишком є циклопентил, необов'язково заміщений однією або декількома нітро, ціано, C₁-C₆-алкільними, C₁-C₆-алкокси групами.

Перевага віддається сполукам формули I, у яких будь-яка алкільна або галоалкільна частина груп R¹ або R², що може являти собою лінійний або розгалужений ланцюг, містить до 10 атомів вуглецю, краще від 1 до 9 атомів вуглецю, найкраще, від 2 до 6 атомів вуглецю, будь-яка алкені-

льна або алкінільна частина замісників R¹ або R² містить до 10 атомів вуглецю, краще, від 2 до 9 атомів вуглецю, найкраще, від 3 до 6 атомів вуглецю, будь-яка циклоалкільна частина замісників R¹ або R² містить від 3 до 10 атомів вуглецю, краще, від 3 до 8 атомів вуглецю, найкраще, від 3 до 6 атомів вуглецю, і будь-яка біциклоалкільна частина замісників R¹ або R² містить від 5 до 9 атомів вуглецю, краще, від 7 до 9 атомів вуглецю. Будь-яка алкільна, алкенільна або алкінільна група може бути лінійною або розгалуженою.

Кращими є сполуки формули I, у яких R¹ являє собою C₁-C₁₀-алкіл з лінійним або розгалуженим ланцюгом, зокрема, C₃-C₁₀-алкільну групу з розгалуженим ланцюгом, C₃-C₈-циклоалкіл, C₅-C₉-біциклоалкіл, C₃-C₈-циклоалкіл-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₁₀-алкокси-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₁₀-галоалкіл або фенільну групу, необов'язково заміщену від одного до трьох разів атомами галогену, або C₁-C₁₀-алкільними або C₁-C₁₀-алкоксигрупами.

Крім того, особлива перевага віддається сполукам формули I, у яких R¹ та R², разом з атомом азоту, що знаходиться між ними, утворюють необов'язково заміщене гетероциклічне кільце, краще, необов'язково заміщене C₃-C₇-гетероциклічне кільце, зокрема, 5- або 6-членний насичений гетероцикл, такий як піролідін, піперидин, морфолін, або тетрагідропіридин, або 5- або 6-членний частково ненасичений гетероцикл, такий як 3,6-дигідро-2H-піридин-1-іл або 2,5-дигідропірол-1-іл, де насичений або ненасичений гетероцикл необов'язково заміщений однією або декількома C₁-C₄-алкільними або C₁-C₂-галоалкільними групами, краще однією або двома метильними групами. Особлива перевага віддається сполукам формули I, у яких R¹ та R² разом утворюють 4-метилпіперидин-1-ільну групу.

Крім того, особлива перевага віддається сполукам формули I, у яких R² являє водень, C₁-C₁₀-алкіл або C₁-C₁₀-галоалкіл, особливо, водень.

Крім того, особлива перевага віддається сполукам формули I, у яких R² означає метил або етил.

Якщо R¹ означає C₁-C₁₀-галоалкіл, краще поліфторований алкіл, зокрема, 2,2,2-трифторетил, 2-(1,1,1-трифторпропіл) або 2-(1,1,1-трифторбутил), R² краще являє водень.

Особлива перевага віддається сполукам формули I, у яких Hal означає фтор, хлор або бром, особливо, фтор.

Крім того, перевага віддається сполукам формули I, у яких L¹ означає водень або фтор, особливо, водень.

Крім того, особлива перевага віддається сполукам формули I, у яких L² означає водень, фтор, трифторметил, аміно, диметиламіно або N-ацетиламіно, особливо, фтор.

Крім того, перевага віддається сполукам формули I, у яких L² означає NHR^b або N(R^b)₂, де R^b означає метил або C(=O)-C₁-C₄-алкіл.

Подібним чином, особлива перевага віддається сполукам формули I, у яких L³ означає водень, фтор, метил, особливо, водень.

Особливо кращим втіленням даного винаходу є сполуки формули I, у яких 6-(2-галофенільна)

група являє один з наступних залишків: 2,3,5-трифторфеніл, 2,4-дифторфеніл, 2-F,4-CF₃-феніл, 2-F,5-CH₃-феніл, 2-Cl,4-F-феніл, 2-F,4-Cl-феніл, 2-F,4-Br-феніл, 2-Cl,4-Br-феніл, 2,3-дифторфеніл, 2,4-дифторфеніл, 2,4,5-трифторфеніл, 2,3,4-трифторфеніл, 2-F,4-NH₂-феніл, 2-F,4-N(CH₃)₂-феніл, 2-F,4-NHC(O)CH₃-феніл, 2-Br,3,5-дифторфеніл, 2-F,4-NO₂-феніл та 2-Cl,4-NO₂-феніл.

Крім того, перевага віддається сполукам формули I, у яких X означає галоген, ціано або метил, краще галоген, такий як хлор або бром, особливо, хлор.

Особливо кращі втілення проміжних сполук стосовно їх змінних замісників відповідають сполукам з радикалами X та L¹-L³ формули I.

В обсяг даного винаходу включені (R) та (S) ізомери сполук загальної формули I, що мають хіральний центр, та їх рацемати, солі, N-оксиди та кислотно-адитивні сполуки.

Що стосується їх використання, особлива перевага віддається сполукам формули I, що наведені у таблицях нижче. Групи, що згадані в таблиці для замісника, і, крім того, їх частина, незалежно від комбінації, у якій вони згадуються, є особливо кращими варіантами відповідних замісників.

Таблиця 1

Сполуки формули I, у якій X означає хлор, Hal, L¹ та L³ означають фтор, L² означає водень, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 2

Сполуки формули I, у якій X означає ціано, Hal, L¹ та L³ означають фтор, L² означає водень, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A.

Таблиця 3

Сполуки формули I, у якій X означає метил, Hal, L¹ та L³ означають фтор, L² означає водень, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 4

Сполуки формули I, у якій X означає метокси, Hal, L¹ та L³ означають фтор, L² означає водень, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 5

Сполуки формули I, у якій X означає хлор, Hal та L² означають фтор, L¹ та L³ означають водень, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 6

Сполуки формули I, у якій X означає ціано, Hal та L² означають фтор, L¹ та L³ означають водень, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 7

Сполуки формули I, у якій X означає метил, Hal та L² означають фтор, L¹ та L³ означають водень, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 8

Сполуки формули I, у якій X означає метокси, Hal та L² означають фтор, L¹ та L³ означають водень, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 9

Сполуки формули I, у якій X означає хлор, Hal означає фтор, L¹ та L³ означають водень, L² означає трифторметил, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 10

Сполуки формули I, у якій X означає ціано, Hal означає фтор, L¹ та L³ означають водень, L² означає трифторметил, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 11

Сполуки формули I, у якій X означає метил, Hal означає фтор, L¹ та L³ означають водень, L² означає трифторметил, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 12

Сполуки формули I, у якій X означає метокси, Hal означає фтор, L¹ та L³ означають водень, L² означає трифторметил, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 13

Сполуки формули I, у якій X означає хлор, Hal означає фтор, L¹ та L² означають водень, L³ означає метил, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 14

Сполуки формули I, у якій X означає ціано, Hal означає фтор, L¹ та L² означають водень, L³ означає метил, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 15

Сполуки формули I, у якій X означає метил, Hal означає фтор, L¹ та L² означають водень, L³ означає метил, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 16

Сполуки формули I, у якій X означає метокси, Hal означає фтор, L¹ та L² означають водень, L³ означає метил, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 17

Сполуки формули I, у якій X та Hal означають хлор, L¹ та L³ означають водень, L² означає фтор, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 18

Сполуки формули I, у якій X означає ціано, Hal означає хлор, L¹ та L³ означають водень, L² означає фтор, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 19

Сполуки формули I, у якій X означає метил, Hal означає хлор, L¹ та L³ означають водень, L² означає фтор, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 20

Сполуки формули I, у якій X означає метокси, Hal означає хлор, L¹ та L³ означають водень, L² означає фтор, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 21

Сполуки формули I, у якій X означає хлор, Hal означає фтор, L¹ та L³ означають водень, L² означає хлор, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 22

Сполуки формули I, у якій X означає ціано, Hal означає фтор, L¹ та L³ означають водень, L² означає хлор, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці A

Таблиця 23

Таблиця 24

Таблица 25

Таблиця 26

Таблиця 27

Таблиця 28

Таблиця 29

Таблиця 30

Таблица 31

Таблица 32

Таблиця 33

Таблиця 34

Таблиця 35

Таблица 36

Сполуки формули I, у якій X означає метокси, Hal та L^2 означають хлор, L^1 та L^3 означають во-

день, а R^1 та R^2 відповідають одному рядку в Таблиці А

Таблица 37

Сполуки формули I, у якій X означає хлор, NaI і L^1 означають фтор, L^2 та L^3 означають водень, а R^1 та R^2 відповідають одному рядку в Таблиці А

Таблица 38

Сполуки формули I, у якій X означає ціано, NaI і L^1 означають фтор, L^2 та L^3 означають водень, а R^1 та R^2 відповідають одному рядку в Таблиці А

Таблица 39

Сполуки формули I, у якій X означає метил, NaI та L^1 означають фтор, L^2 та L^3 означають водень, а R^1 та R^2 відповідають одному рядку в Таблиці А

Таблица 40

Сполуки формули I, у якій X означає метокси, Hal та L^1 означають фтор, L^2 та L^3 означають водень, а R^1 та R^2 відповідають одному рядку в Таблиці А

Таблица 41

Сполуки формули I, у якій X означає хлор, NaI та L³ означають фтор, L¹ та L² означають водень, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці А

Таблиця 42

Сполуки формули I, у якій X означає ціано, NaI та L^3 означають фтор, L^1 та L^2 означають водень, а R^1 та R^2 відповідають одному рядку в Таблиці А

Таблица 43

Сполуки формули I, у якій X означає метил, NaI та L^3 означають фтор, L^1 та L^2 означають водень, а R^1 та R^2 відповідають одному рядку в Таблиці А

Таблиця 44

Сполуки формули I, у якій X означає метокси, NaI та L³ означають фтор, L¹ та L² означають водень, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці А

Таблица 45

Сполуки формули I, у якій X означає хлор, Hal , L^2 та L^3 означають фтор, L^1 означає водень, а R^1 та R^2 відповідають одному рядку в Таблиці А

Таблица 46

Сполуки формули I, у якій X означає ціано, Hal, L² та L³ означають фтор, L¹ означає водень, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці А

Таблица 47

Сполуки формули I, у якій X означає метил, Hal, L² та L³ означають фтор, L¹ означає водень, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці А

Таблица 48

Сполуки формули I, у якій X означає метокси, Hal, L² та L³ означають фтор, L¹ означає водень, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці А

Таблица 49

Сполуки формули I, у якій X означає хлор, NaI, L^1 та L^2 означають фтор, L^3 означає водень а R^1 та R^2 відповідають одному рядку в Таблиці А

Таблиця 50

Сполуки формули I, у якій X означає ціано, Hal, L¹ та L² означають фтор, L³ означає водень, а R¹ та R² відповідають одному рядку в Таблиці А

Таблица 51

Таблиця А

№.	R ¹	R ²
A-1	CH ₂ CH ₃	H
A-2	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-3	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-4	CH ₂ CF ₃	H
A-5	CH ₂ CF ₃	CH ₃
A-6	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-7	CH ₂ CCl ₃	H
A-8	CH ₂ CCl ₃	CH ₃
A-9	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-10	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-11	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-12	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-13	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-14	CH(CH ₃) ₂	H
A-15	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-16	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-17	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-18	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-19	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-20	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-21	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-22	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-23	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-24	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-25	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-26	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-27	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-28	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-29	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-30	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-31	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-32	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-33	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-34	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-35	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-36	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-37	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-38	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-39	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-40	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-41	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-42	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-43	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-44	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-45	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-46	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-47	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-48	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-49	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-50	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-51	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-52	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-53	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-54	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-55	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-56	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-57	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-58	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-59	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-60	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-61	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-62	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H
A-63	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₃
A-64	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-65	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	H
A-66	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₃

A-67	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-68	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-69	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-70	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-71	циклопентил	H
A-72	циклопентил	CH ₃
A-73	циклопентил	CH ₂ CH ₃
A-74	циклогексил	H
A-75	циклогексил	CH ₃
A-76	циклогексил	CH ₂ CH ₃
A-77	-(CH ₂) ₂ CH=CHCH ₂ -	
A-78	-(CH ₂) ₂ C(CH ₃)=CHCH ₂ -	
A-79	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-80	-(CH ₂) ₂ CHF(CH ₂) ₂ -	
A-81	-(CH ₂) ₃ CHFCH ₂ -	
A-82	-(CH ₂) ₂ CH(CF ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-83	-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	
A-84	-(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ -	
A-85	-(CH ₂) ₅ -	
A-86	-(CH ₂) ₄ -	
A-87	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -	
A-88	-CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ -	
A-89	-CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	

Сполуки I придатні як фунгіциди. Вони проявляють гарну активність проти широкого спектра фітопатогенних грибків, зокрема, проти класів Ascomycetes, Deuteromycetes, Phycmycetes та Basidiomycetes. Деякі з них діють системно та можуть застосовуватися при захисті рослин як листяні та ґрунтові фунгіциди. Вони мають особливе значення при боротьбі з великою кількістю фітопатогенних грибків на різних культурних рослинах, таких, як пшениця, жито, ячмінь, овес, рис, кукурудза, злаки, банани, бавовник, соєві, кава, цукровий очерет, виноград, плодові та декоративні рослини, та на овочевих культурах, таких, як огірки, бобові, томати, картопля та гарбузові, а також на насінні цих рослин.

Особливо вони придатні для боротьби з наступними хворобами рослин:

види *Alternaria Species* на овочевих та плод-ових рослинах,

види *Bipolaris*- і *Drechslera* на зернових, рисі та дернині,

Blumeria graminis (пілоподібна несправжня борошниста роса) на зернових,

Botrytis cinerea (цвілеподібна сіра гниль) на полуниці, овочевих, декоративних культурах та на виноградних лозах,

Erysiphe cichoracearum та *Sphaerotheca fuliginea* на гарбузових,

види *Fusarium*- і *Verticillium* на різних рослинах,

види *Mycosphaerella* на зернових, бананових та земляних горіхах,

Phytophthora infestans на картоплі та помідорах,

Plasmopara viticola на виноградних лозах,

Podosphaera leucotricha на яблунях,

Pseudocercospora herpotrichoides на пшениці та ячмені,

види *Pseudoperonospora* на хмелі та огірках,

види *Rhizoctonia* на зернових,

Rhizoctonia oryzae на рисі,

види *Rhizoctonia* на бавовнику, рисі та дернині,

Septoria tritici та *Stagonospora nodorum* на пшениці,

Uncinula necator на виноградних лозах,

Ustilago на зернових та цукровому очереті, та види *Venturia* (парша) на яблуневих та грушевих.

Крім того, сполуки формули I придатні для боротьби зі шкідливими грибами, такими, як *Raecilomyces variotii* при захисті матеріалів (наприклад, деревини, паперу, дисперсій для покриттів, волокон, відповідно, тканин) і при захисті продуктів, що зберігаються.

Сполуки формули I застосовують шляхом обробки грибків або рослин, що підлягають захисту від інфекції грибами, насіння, матеріалів або ґрунту фунгіцидною активною кількістю діючих речовин. Застосування може здійснюватися як перед, так і після ураження грибками матеріалів, рослин або насіння.

Загалом фунгіцидні композиції містять від 0,1 до 95, краще, від 0,5 до 90 мас.% діючої речовини.

При застосуванні для захисту культурних рослин норми витрати, залежно від бажаного ефекту, становлять між 0,01 та 2,0 кг діючої речовини на гектар.

При обробці посівного зерна, загалом, потрібно від 0,001 до 0,1 г, краще від 0,01 до 0,05 г діючої речовини на кг посівного матеріалу.

При використанні для захисту матеріалів або продуктів, що перебувають на зберіганні, норма витрати діючої речовини залежить від області застосування та бажаного результату. Звичайні норми витрати при захисті матеріалів становлять, наприклад, від 0,001 г до 2 кг, краще, від 0,005 г до 1 кг діючої речовини на кубометр матеріалу, що оброблюється.

Сполуки формули I можуть бути переведені у звичайні препаративні форми, наприклад, розчини, емульсії, суспензії, дуети, порошки, паста та гранули. Форма, що використовується залежить від конкретної мети; у кожному разі вона повинна забезпечувати тонкий та рівномірний розподіл сполуки відповідно до винаходу.

Препаративні форми одержують відомим чином, наприклад, розведенням діючої речовини розчинниками і/або носіями, за бажанням із застосуванням емульгаторів або диспергаторів. Придатними розчинниками/допоміжними речовинами є наступні:

вода, ароматичні розчинники (наприклад, продукти *Solvesso*, ксилол), парафіни (наприклад, фракції нафти), спирти (наприклад, метанол, бутанол, пентанол, бензиловий спирт), кетони (наприклад, циклогексанон, гамма-бутиролактон), піролідони (NMP, NOP), ацетати (глікольдіацетат), гліколі, диметиламіди жирних кислот, жирні кислоти та складні ефіри жирних кислот. У принципі можуть застосовуватися суміші розчинників;

носії, такі, як природні подрібнені породи (наприклад, каолін, глинозем, тальк, крейда) та синтетичні подрібнені породи (наприклад, високодисперсний кремнезем, силікати); емульгатори, такі, як неіоногенні та аніонні емульгатори (наприклад, ефіри поліоксіетилену та жирних спиртів, алкілсульфонати та арилсульфонати) та диспергатори,

такі як, лігнінсульфітний відпрацьований луг або метилцелюлоза.

Як поверхнево-активні речовини придатні солі лужних, лужноземельних металів та амонієві солі лігнінсульфонової кислоти, нафталінсульфонокислоти, фенолсульфонокислоти, дибутилнафталінсульфонокислоти, алкіларилсульфонати, алкілсульфати, алкілсульфонати, сульфати жирних спиртів, жирні кислоти та сульфатовані гліколеві ефіри жирних спиртів, крім того конденсати сульфонованого нафталіну та похідних нафталіну з формальдегідом, конденсати нафталіну або нафталінсульфонової кислоти з фенолом та формальдегідом, поліоксіетиленоктилфеніловий ефір, етоксирований ізооктилфенол, октилфенол, нонілфенол, алкілфенілполігліколеві ефіри, трибутилфенілполігліколевий ефір, тристеарилфенілполігліколевий ефір, алкіларилполіефірні спирти, продукти конденсації етиленоксиду та спирту та жирного спирту, етоксирована касторова олія, поліоксіетиленалкілові ефіри, етоксирований поліоксипропілен, ацеталь полігліколевого ефіру лаурилового спирту, складні ефіри сорбіту, відпрацьований лігнінсульфітний луг або метилцелюлоза.

Речовинами, придатними для одержання розчинів, що розприскують безпосередньо, емульсій, паст або масляних дисперсій є фракції перегонки нафти із середньою та високою точками кипіння, такі, як гас або дизельне масло, крім того, вугільні дьогтьові масла або масла рослинного або тваринного походження, аліфатичні, циклічні та ароматичні вуглеводні, наприклад, толуол, ксилол, парафін, тетрагідронафталін, алкіловані нафталіни або їх похідні, метанол, етанол, пропанол, бутанол, циклогексанол, циклогексанон, ізофорон, сильно полярні розчинники, наприклад, диметилсульфоксид, N-метилпіролідон і вода. Порошкові препарати, препарати для обпилювання та обпудрювання можуть бути виготовлені шляхом змішування або спільного розмелу діючих речовин із твердим носієм.

Грануляти, наприклад, покриті оболонкою гранули, імпрегновані гранули або гомогенні гранули можуть бути одержані шляхом зв'язування діючої речовини із твердими носіями. Прикладами твердих наповнювачів є мінеральні землі, такі, як кремнезем, силікагелі, силікати, тальк, каолін, атаклау, вапняк, вапно, крейда, болюс, лес, глина, доломіт, діатомова земля, сульфат кальцію, сульфат магнію, окис магнію, подрібнені синтетичні матеріали, добрива, такі як, наприклад, сульфат амонію, фосфат амонію, нітрат амонію, сечовини та продукти рослинного походження, такі, як зернове борошно, борошно деревної кори, деревне борошно та борошно горіхової шкарлупи, порошки целюлози та інші тверді носії.

Загалом, композиції містять від 0,01 до 95 мас.%, краще від 0,1 до 90 мас.% діючої речовини. Застосовують діючі речовини із чистотою від 90% до 100%, краще, від 95% до 100% (за спектром ЯМР).

Далі наведені приклади складів:

1. Продукти для розведення водою

A Розчинні концентрати (SL)

10мас. частин сполуки відповідно до винаходу розчиняють у воді або у водорозчинному розчиннику. Альтернативно додають змочувальний агент або інші допоміжні речовини. Діюча речовина розчиняється при розведенні водою.

В Концентрати, що диспергуються (DC)

20мас. частин сполуки відповідно до винаходу розчиняють у циклогексаноні з додаванням диспергатора, наприклад, полівінілпіролідону. Розведення водою приводить до утворення дисперсії.

С Концентрати, що емульгуються (EC)

15мас. частин сполуки відповідно до винаходу розчиняють у ксилолі з додаванням додецилбензолсульфонату кальцію та етоксифікованої касторової олії (у кожному випадку 5% концентрації). Розведення водою приводить до утворення емульсії.

Д) Емульсії (EW, EO)

40мас. частин сполуки відповідно до винаходу розчиняють у ксилолі з додаванням додецилбензолсульфонату кальцію та етоксифікованої касторової олії (у кожному випадку 5% концентрації). Цю суміш вводять у воду за допомогою емульгатора (Ultraturax) і перетворюють у гомогенну емульсію. Розведення водою приводить до утворення емульсії.

Е Суспензії (SC, OD)

У кульовому млині з мішалкою подрібнюють 20мас. частин сполуки відповідно до винаходу з додаванням диспергатора, змочувальних агентів та води або органічного розчинника, одержуючи тонкодисперсну суспензію активного інгредієнта. Розведенням водою одержують стабільну суспензію активного інгредієнта.

Ф) Гранули, що диспергуються у воді та водорозчинні гранули (WG, SG)

50мас. частин сполуки відповідно до винаходу тонко подрібнюють із додаванням диспергаторів і змочувальних агентів та перетворюють у гранули, що диспергуються у воді та розчинні у воді гранули за допомогою технічних пристроїв (наприклад, екструзією, у скрубері із розбризкуючим пристроєм, у псевдозрідженому шарі). Розведенням водою одержують стабільну дисперсію або розчин активного інгредієнта.

Г) Порошки, що диспергуються у воді та водорозчинні порошки (WP, SP)

75мас. частин сполуки відповідно до винаходу подрібнюють в електричному млині з додаванням диспергатора, змочувальних агентів і силікагелю. Розведенням водою одержують стабільну дисперсію або розчин з активним інгредієнтом.

2. Продукти, які застосовуються нерозбавленими

Н) Розпилювані порошки (DP)

5мас. частин сполуки відповідно до винаходу тонко подрібнюють і змішують із 95% тонкоподрібненого каоліну до утворення однорідної суміші. Це приводить до одержання розпилюваного продукту.

І) Гранули (GR, FG, GG, MG)

0,5 мас. частин сполуки відповідно до винаходу тонко подрібнюють і поєднують із 95,5% носіїв. Сучасними методами є екструзія, сушіння розпиленням або використання псевдозрідженого шару.

Це приводить до одержання гранул, які застосовують нерозбавленими.

J) ULV-розчини (UL)

10мас. частин сполуки відповідно до винаходу розчиняють в органічному розчиннику, наприклад, ксилолі. Це приводить до одержання продукту, який застосовують нерозбавленим.

Діючі речовини можуть застосовуватися самі по собі, у формі своїх композицій або в одержуваних з них формі застосування, наприклад, можуть бути приготовлені у формі призначених для безпосереднього обприскування розчинів, порошків, суспензій або дисперсій, емульсій, масляних дисперсій, паст, розпилюваних продуктів, препаратів для розбризкування або гранул шляхом обприскування, дрібнокрапельного обприскування, обпилювання, обпудрювання або поливу. Форми, що використовуються загалом залежать від мети застосування, але у всіх випадках повинен бути забезпечений максимально тонкий розподіл активних інгредієнтів відповідно до винаходу.

Водні форми, що використовуються можуть бути приготовлені з концентратів емульсій, паст або змочуваних порошків (порошки для розбризкування, масляні дисперсії) шляхом додавання води. Для виготовлення емульсій, паст або масляних дисперсій речовини як такі, або ж розчинені в маслі або розчиннику, можуть бути гомогенізовані у воді за допомогою змочувальних агентів, активаторів адгезії, диспергаторів або емульгаторів. Альтернативно, можливе приготування концентратів, що складаються з діючої речовини, змочувального агента, активатора адгезії, диспергатора або емульгатора та, за необхідності, розчинника або масла, які придатні для розведення водою.

Концентрація діючої речовини в готових до застосування препаратах може варіюватися в значних межах. Загалом, вона становить від 0,0001 до 10%, краще, від 0,01 до 1%.

Діючі речовини можуть також з успіхом застосовуватися при особливо низьких нормах витрати (ULV), причому є можливість використовувати сполуки з вмістом більш ніж 95мас.% активного інгредієнта або навіть застосовувати активний інгредієнт без добавок.

До діючих речовин можуть додаватися різного типу масла, змочувальні агенти, ад'юванти, гербіциди, фунгіциди, інші пестициди або бактерициди, у разі потреби, також і безпосередньо перед застосуванням (суміші в баку). Ці речовини можуть змішуватися з речовинами за винаходом у масовому співвідношенні від 1:10 до 10:1.

При застосуванні як фунгіциди, у композиції відповідно до винаходу можуть знаходитися також і інші діючі речовини, наприклад, гербіциди, інсектициди, регулятори росту, фунгіциди або ж добрива. При змішуванні сполук формули I або композицій, що їх містять у формі фунгіцидних засобів, з іншими фунгіцидами в багатьох випадках досягається розширення спектра фунгіцидної дії.

Нижче наведено перелік фунгіцидів, які можна застосовувати разом зі сполуками згідно винаходу, який призначений для ілюстрації можливості їх комбінування, однак не накладає ніяких обмежень;

- ацилаланіни, такі як беналаксил, металаксил, офурац, оксидиксил,

- похідні аміну, такі як алдиморф, додин, деморф, фенпропіморф, фенпропідин, квазатин, іміноктадин, спіроксамін, тридеморф,

- анілінопіримідини, такі як піриметаніл, мепаніпірим або циродиніл,

- антибіотики, такі як циклогексимід, гризеофульвін, касугаміцин, натаміцин, поліоксин або стрептоміцин,

- азоли, такі як бітертанол, бромоконазол, ципроконазол, дифеноконазол, динітроконазол, епоксиконазол, фенбуконазол, флухіконазол, флузілазол, гексаконазол, імазаліл, метконазол, міклобутаніл, пенконазол, пропіконазол, прохлораз, протіконазол, тебуконазол, триадимефон, триадименол, трифлумізол, тритіконазол,

- дикарбоксиміди, такі як іпродіон, міклозолін, процимідон, вінклозолін,

- дитіокарбамати, такі як фербам, набам, манеб, манкозеб, метам, метирам, пропінеб, полікарбамат, тирам, зирам, зинеб,

- гетероциклічні сполуки, такі як анілазин, беноміл, боскалід, карбендазим, карбоксин, оксикарбоксин, ціанофамід, дазомет, дитіанон, фамоксадон, фенамідон, фенаримол, фуберидазол, флутоланіл, фураметпір, ізопротіолан, мепроніл, нуаримол, пробеназол, прохіназид, пірифенокс, пірохілон, хіноксифен, силтіофам, тіабендазол, тифлузамід, тіофанатметил, тіадиніл, трицикл азол, трифорин,

- нитрофенільні фунгіциди, такі як Бордоська суміш, ацетат міді, оксихлорид міді, основний сульфат міді,

- нітрофенільні похідні, такі як бінапакрил, динокап, динобутон, нітрофтал ізопропіл,

- феніл піроли, такі як фенпиклоніл або флудіоксоніл,

- сірка,

- інші фунгіциди, такі як ацибензолар-S-метил, бенітавалікарб, карпропамід, хлоротгалоніл, цифлуфенамід, цимоксаніл, дазомет, дикломезин, диклоцимет, діетофенкарб, едифенфос, етабоксам, фенгексамід, фентин-ацетат, феноксаніл, феримзон, флуазинам, фозетил, фозетил-алюміній, іпровалікарб, гексахлорбензол, метрафенон, пенцикурон, пропамокарб, фталід, толклофос-метил, хінтозен, зоксамід,

- стробілурини, такі як азоксистробін, димоксистробін, флуоксастробін, крезоксим-метил, метоміностробін, оризастробін, пікоксистробін, піраклостробін або трифлуксистробін,

- похідні сульфенової кислоти, такі як каптафол, каптан, дихлофлуанід, фолпет, толілфлуанід

- цінемамід та аналоги, такі як диметоморф, флуметовер або флуморф.

Приклади синтезу

З врахуванням відповідних замін вихідних сполук протоколи, що наведені в прикладах синтезу нижче, використовувалися для одержання інших сполук формули I. Одержані сполуки I, разом з їх фізичними даними, наведені в Таблиці I, яка наведена далі.

Приклад 1 Одержання діетил-(2,3,5-трифторфеніл)малонату

Етил-2-(2,3,5-трифторфеніл)ацетат (29г) повільно додавали до суміші діетилкарбонату (63г) та гідриду натрію (9,5г) у толуолі (350мл). Після кип'ятіння впродовж 3 годин реакційну суміш охолоджували, обробляли крижаною водою та промивали водою. Органічний шар відокремлювали, сушили та фільтрували. Фільтрат концентрували у вакуумі з одержанням 32г зазначеної в заголовку сполуки.

Приклад 2 Одержання 5,7-дигідрокси-6-(2,3,5-трифторфеніл)-[1,2,4]-триазоло-[1,5-а]піримідину

Суміш 3-аміно-1,2,4-триазолу (14г), діетил-(2,3,5-трифторфеніл)малонату (0,17моль, що одержаний в Прикладі 1) і трибутиламіну (50мл) нагрівали при 180°C впродовж 6 годин. Реакційну суміш охолоджували до приблизно 70°C. Після додавання водного гідроксиду натрію (21г/200мл H₂O) реакційну суміш перемішували впродовж 30 хвилин. Після відділення органічної фази водну фазу екстрагували діетиловим ефіром. Водну фазу підкисляли концентрованою хлористоводневою кислотою. Осад збирали фільтрацією та сушили з одержанням 43г зазначеної в заголовку сполуки.

Приклад 3 Одержання 5,7-дихлор-6-(2,3,5-трифторфеніл)-[1,2,4]-триазоло-[1,5-а]піримідину

Суміш 5,7-дигідрокси-6-(2,3,5-трифторфеніл)-[1,2,4]-триазоло-[1,5-а]піримідину (30г, що одержаний в Прикладі 2) та оксихлориду фосфору (50мл) кип'ятили впродовж 8 годин. Оксихлорид фосфору частково відганяли. Залишок виливали в суміш дихлорметану та води. Органічний шар відокремлювали, сушили та фільтрували. Фільтрат концентрували у вакуумі з одержанням 26г зазначеної в заголовку сполуки з Т.пл. 191°C.

Приклад 4 Одержання 5-хлор-6-(2,3,5-трифторфеніл)-7-ізопропіламіно-[1,2,4]-триазоло[1,5-а]піримідину [I-2]

Суміш ізопропіламіну (1,5ммоль), триетиламіну (1,5ммоль) і дихлорметану (10мл) додавали до суміші 5,7-дихлор-6-(2,3,5-трифторфеніл)-[1,2,4]-триазоло[1,5-а]піримідину (1,5ммоль, що одержаний в Прикладі 3) і дихлорметану (20мл) при перемішуванні. Реакційну суміш перемішували впродовж 16 годин при температурі від 20 до 25°C та промивали 5% хлористоводневою кислотою. Органічний шар відокремлювали, сушили та фільтрували. Фільтрат випарювали та залишок очищали хроматографією на колонці з одержанням 0,42г зазначеної в заголовку сполуки з Т.пл. 151°C.

Приклад 5 Одержання 5-ціано-6-(2-хлор-4-фторфеніл)-7-(4-метилпіперидин-1-іл)-[1,2,4]-триазоло[1,5-а]піримідину

Суміш 5-хлор-6-(2-хлор-4-фторфеніл)-7-(4-метилпіперидин-1-іл)-[1,2,4]-триазоло-[1,5-а]піримідину (0,1моль) і ціаніду тетраетиламонію (0,25моль) в 750мл диметилформаміду (ДМФ) перемішували впродовж 16 годин при температурі від 20 до 25°C. До цієї суміші додавали воду та метил-трет-бутиловий ефір (МТБЕ), органічну фазу відокремлювали, промивали водою, сушили та фільтрували. Фільтрат випарювали, і залишок очищали хроматографією на колонці з одержанням 5,91г зазначеної в заголовку сполуки з Т.пл. 247°C.

Приклад 6 Одержання 5-метокси-6-(2-хлор-4-фторфеніл)-7-(4-метилпіперидин-1-іл)-[1,2,4]-триазоло[1,5-а]піримідину

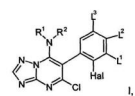
До розчину 5-хлор-6-(2-хлор-4-фторфеніл)-7-(4-метилпіперидин-1-іл)-[1,2,4]-триазоло[1,5-а]піримідину (65 ммоль) в 400мл сухого метанолу додавали розчин метанолату натрію (30%, 71,5ммоль) при температурі від 20 до 25°C. Цю суміш перемішували впродовж 16 годин при температурі від 20 до 25°C. Метанол випарювали, і залишок розчиняли в дихлорметані. Органічну фазу промивали водою, сушили та фільтрували. Фільтрат випарювали при зниженому тиску і залишок очищали хроматографією на колонці з одержанням 4,52г зазначеної в заголовку сполуки з Т.пл. 186°C.

Приклад 7 Одержання 5-метил-6-(2-хлор-4-фторфеніл)-7-(4-метилпіперидин-1-іл)-[1,2,4]-триазоло[1,5-а]піримідину

Суміш 20мл діетилмалонату та NaH (0,27г 50% дисперсії в мінеральному маслі, 5,65ммоль) в 50мл ацетонітрилу перемішували при температурі від 20 до 25°C впродовж приблизно 2 годин. До цієї суміші додавали 5-хлор-6-(2-хлор-4-фторфеніл)-7-(4-метилпіперидин-1-іл)-[1,2,4]-триазоло[1,5-а]піримідин (4,71ммоль). Реакційну суміш нагрівали до 60°C та перемішували впродовж приблизно 20 годин. Додавали водний розчин хлориду амонію (50мл) і суміш підкисляли розведеною HCl. Реакційну суміш екстрагували МТБЕ. Об'єднані органічні фази сушили та концентрували. Залишок очищали хроматографією на колонці.

Одержаний чистий продукт розбавляли концентрованою HCl і нагрівали до 80°C впродовж приблизно 24 годин. Цю реакційну суміш охолоджували та доводили рН до значення 5 шляхом додавання водного розчину NaOH, і потім екстрагували МТБЕ. Об'єднані органічні фази сушили, концентрували та очищали хроматографією на колонці з одержанням 0,78г зазначеної в заголовку сполуки з Т.пл. 236°C.

Таблиця 1



№	R ¹	R ²	Hal	L ¹	L ²	L ³	фіз. данні (Т.пл. [°C])
I-1	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	128
I-2	CH(CH ₃) ₂	H	F	F	H	F	151
I-3	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		F	F	H	F	171
I-4	циклопентил	H	F	F	H	F	111
I-5	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	165
I-6	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	107
I-7	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	F	F	H	F	172
I-8	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	F	H	F	99
I-9	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	F	H	F	94
I-10	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	F	H	F	94
I-11	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	F	H	F	113 / 114
I-12	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	F	H	F	108 / 122
I-13	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	F	H	F	108 / 122
I-14	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	F	H	F	138 / 129
I-15	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	F	H	F	129 / 121

I-16	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	F	H	F	129 / 121
I-17	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	F	H	F	164
I-18	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	F	H	F	147
I-19	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	F	H	F	147
I-20	CH ₂ CF ₃	H	F	F	H	F	161
I-21	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	F	H	F	H	105
I-22	CH(CH ₃) ₂	H	F	H	F	H	159
I-23	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		F	H	F	H	208
I-24	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	F	H	86
I-25	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	H	F	H	160
I-26	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	F	H	151
I-27	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	F	H	116
I-28	CH ₂ CF ₃	H	F	H	F	H	181
I-29	CH(CH ₃) ₂	H	F	H	Br	H	83
I-30	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		F	H	Br	H	175
I-31	циклопентил	H	F	H	Br	H	161
I-32	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	F	H	Br	H	142
I-33	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	Br	H	81
I-34	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	H	Br	H	196
I-35	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	Br	H	157
I-36	CH ₂ CF ₃	H	F	H	Br	H	108
I-37	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	F	F	H	H	116
I-38	CH(CH ₃) ₂	H	F	F	H	H	138
I-39	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		F	F	H	H	208
I-40	циклопентил	H	F	F	H	H	65
I-41	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	F	F	H	H	135
I-42	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	F	H	H	140
I-43	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	F	H	H	F	121
I-44	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		F	H	H	F	181
I-45	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	H	F	134
I-46	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	H	H	F	184
I-47	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	F	H	F	F	138
I-48	CH(CH ₃) ₂	H	F	H	F	F	138
I-49	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		F	H	F	F	142
I-50	циклопентил	H	F	H	F	F	165
I-51	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	H	F	F	149
I-52	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	F	F	159
I-53	CH ₂ CF ₃	H	F	H	F	F	178
I-54	CH(CH ₃) ₂	H	F	F	F	H	139
I-55	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		F	F	F	H	241
I-56	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	F	F	F	H	152
I-57	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	F	F	H	123
I-58	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	F	F	H	160
I-59	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	F	F	H	157
I-60	CH ₂ CF ₃	H	F	F	F	H	174
I-61	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		F	H	NH ₂	H	249
I-62	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	NH ₂	H	196
I-63	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		F	H	N(CH ₃) ₂	H	143
I-64	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	N(CH ₃) ₂	H	147
I-65	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		F	H	NHCOCH ₃	H	135
I-66	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	NHCOCH ₃	H	147
I-67	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Br	F	H	F	139
I-68	CH(CH ₃) ₂	H	Br	F	H	F	138
I-69	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Br	F	H	F	153
I-70	циклопентил	H	Br	F	H	F	117
I-71	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Br	F	H	F	121
I-72	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Br	F	H	F	133
I-73	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Br	F	H	F	133
I-74	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Br	F	H	F	113
I-75	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Br	F	H	F	125
I-76	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Br	F	H	F	125
I-77	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Br	F	H	F	119
I-78	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Br	F	H	F	130
I-79	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Br	F	H	F	130
I-80	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	Br	F	H	F	65
I-81	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	Br	F	H	F	78
I-82	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	Br	F	H	F	78
I-83	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	F	H	79
I-84	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	F	H	79
I-85	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	H	F	H	133
I-86	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	H	F	H	133
I-87	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	H	F	H	161
I-88	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	H	F	H	161
I-89	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	F	H	116
I-90	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	F	H	Cl	H	123
I-91	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	Cl	H	110
I-92	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	Cl	H	99
I-93	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	Cl	H	99
I-94	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	H	Cl	H	141
I-95	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	H	Cl	H	131
I-96	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	H	Cl	H	131
I-97	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	H	Cl	H	191
I-98	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	H	Cl	H	186
I-99	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	H	Cl	H	185
I-100	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	Cl	H	162
I-101	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	Cl	H	162
I-102	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	Cl	H	162
I-103	CH ₂ CF ₃	H	F	H	Cl	H	146

I-104	C(CH ₃) ₂ CH(CH ₃) ₂	H	F	H	F	H	130
I-105	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	F	H	CF ₃	H	140
I-106	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		F	H	CF ₃	H	177
I-107	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	CF ₃	H	137
I-108	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	CF ₃	H	128
I-109	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	CF ₃	H	128
I-110	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	H	CF ₃	H	150
I-111	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	H	CF ₃	H	143
I-112	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	H	CF ₃	H	143
I-113	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	H	CF ₃	H	193
I-114	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	H	CF ₃	H	195
I-115	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	H	CF ₃	H	194
I-116	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	CF ₃	H	167
I-117	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	CF ₃	H	135
I-118	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	CF ₃	H	135
I-119	CH ₂ CF ₃	H	F	H	CF ₃	H	143
I-120	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	F	H	H	CH ₃	121
I-121	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		F	H	H	CH ₃	141
I-122	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	H	CH ₃	134
I-123	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	H	CH ₃	131
I-124	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	H	CH ₃	131
I-125	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	H	H	CH ₃	158
I-126	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	H	H	CH ₃	159
I-127	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	H	H	CH ₃	159
I-128	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	H	H	CH ₃	181
I-129	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	H	H	CH ₃	171
I-130	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	H	H	CH ₃	171
I-131	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	H	CH ₃	170
I-132	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	H	CH ₃	140
I-133	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	H	CH ₃	140
I-134	CH ₂ CF ₃	H	F	H	H	CH ₃	185
I-135	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	H	F	H	128
I-136	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	H	F	H	124
I-137	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	H	F	H	155
I-138	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	H	F	H	130
I-139	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	Cl	H	F	H	131
I-140	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	H	F	H	121
I-141	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	H	F	H	108
I-142	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	Cl	H	F	H	109
I-143	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	H	F	H	156
I-144	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	H	F	H	153
I-145	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	H	F	H	153
I-146	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	H	F	H	194
I-147	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	H	F	H	155
I-148	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	H	F	H	155
I-149	CH ₂ CF ₃	H	Cl	H	F	H	176
I-150	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		F	H	Cl	H	187
I-151	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	F	H	H	133
I-152	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	F	H	H	137
I-153	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	F	H	H	137
I-154	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	F	H	H	135
I-155	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	F	H	H	124
I-156	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	F	H	H	124
I-157	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	F	H	H	142
I-158	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	F	H	H	142
I-159	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	F	H	H	187
I-160	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	F	H	H	149
I-161	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	F	H	H	149
I-162	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	F	H	H	186
I-163	CH ₂ CF ₃	H	F	F	H	F	131
I-164	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	H	F	131
I-165	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	H	F	159
I-166	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	H	H	F	162



При наявності певних хіральних груп R¹ та внаслідок утрудненого обертання фенільної групи можуть існувати два діастереомери, що можуть відрізнятися за своїми фізичними властивостями.

Приклади дії проти грибків

Фунгіцидну дію сполук формули I було продемонстровано в наступних експериментах:

Діючі речовини, окремо або спільно, використовували для одержання вихідного розчину, що містить 0,25мас.% діючої речовини в ацетоні або ДМСО. До цього розчину додавали 1мас.% емуль-

гатора Uniperol® EL (змочувальний агент з емульгуювальною та диспергуючою дією на основі етоксированих алкілфенолів) і суміш розбавляли водою до одержання необхідної концентрації.

Приклад застосування 1 - Фунгіцидний контроль ранньої попелиці на помідорах «*Alternaria solani*»

Листя розсади помідорів у горщиках сорту "Grobe Fleischtomate St. Pierre" обприскували водною суспензією, що містить діючу речовину в концентрації, що наведена нижче. Наступного дня листки інфікували суспензією зооспор *Alternaria solani* (0,17×10⁶ спор на мл 2% біосолодового розчину). Рослини потім поміщали в зволожувальну камеру при температурі від 20 до 22°C. Через 5 днів захворювання розвинулося до такого високого ступеня на необроблених рослинах, що фунгіцидну активність речовин неможливо було оцінити.

В цьому досліді рослини, які були оброблені 250млн.ч. сполук I-2, I-4, I-8, I-17, I-20, I-21, I-25, I-28, I-90, I-91, I-94, I-97 та I-101, відповідно, показали інфікованість не більше, ніж 7%, у той час як необроблені рослини були інфіковані на до 90%.

Приклад використання 2 - Контроль сірої цвілі (*Botrytis cinerea*) на листках паприки

Розсаду паприки обприскували до стикання на стадії четвертого - п'ятого листка водною суспензією, що містить концентрацію діючої речовини, наведену нижче. Наступного дня рослини інюкулювали суспензією спор *Botrytis cinerea*, що містить 1,7×10⁶ спор на мл в 2мас.% водному біосолодовому розчині. Потім інфіковані рослини витримували в зволожувальній камері впродовж п'яти днів при 22-24°C. Ступінь поширення грибка оцінювали візуально як % ураження всієї поверхні листка.

В даному досліді рослини, які були оброблені 250млн.ч. сполук I-2, I-4, I-5, I-8, I-17 та I-20, відповідно, показали інфікованість не більше, ніж 5%, у той час як необроблені рослини були інфіковані на до 85%.

Приклад використання 3 - Фунгіцидний контроль несправжньої борошнистої роси (*Plasmopara viticola*) на винограді

Листя вирощених у горщиках виноградних лоз сорту "Miller-Thurgau" обприскували водними розчинами, що одержані з вихідного розчину, який має концентрацію діючої речовини, зазначену нижче. Наступного дня їх інюкулювали водною суспензією спор *Plasmopara viticola* шляхом набризгування її на нижню сторону листків. Потім дослідні рослини поміщали на 48 годин в зволожувальну камеру з температурою близько 24°C та відносною вологістю, близькою до 100%. Впродовж 5 днів проводили культивування в теплиці при температурі від 20 до 30°C. Для стимулювання прояви симптомів захворювання рослини знову переносили в зволожувальну камеру на 16 годин. Потім ступінь грибкового впливу на нижню сторону листків візуально оцінювали як % ураженої площі листків.

В цьому досліді рослини, які були оброблені 250млн.ч. сполук I-2, I-4, I-8, I-17 та I-20, відповідно, показали інфікованість не більше, ніж 15%, у той час як необроблені рослини були інфіковані на до 95%.

Приклад використання 4 - Дія на *Pyricularia oryzae* (захисна дія)

Листя вирощеної в горщиках розсади рису сорту "Tai-Nong 67" обприскували до стікання водною суспензією, що містить концентрацію діючої речовини, зазначену нижче. Наступного дня рослини інюкулювали водною суспензією спор *Pyricularia oryzae*. Потім рослини поміщали на 6 днів в зволожувальну камеру з температурою від 22 до 24°C та відотною вологістю від 95 до 99%. Ступінь поширення грибків оцінювали як % ушкодження всієї поверхні листка.

В даному досліді рослини, які були оброблені 250млн.ч. сполук I-2, I-4, I-5 та I-20, відповідно, показали інфікованість не більше, ніж 15%, у той час як необроблені рослини були інфіковані на до 80%.

Приклад використання 5 - Контроль плямистості на ячмені, що викликана *Pyrenophora teres*

Листя вирощеної в горщиках розсади ячменя сорту "Ігі" обприскували до стікання водною суспензією, що має концентрацію діючої речовини, яка зазначена нижче. Наступного дня оброблені рослини інюкулювали водною суспензією спор *Pyrenophora* [син. *Drechslera*] *teres*. Потім дослідні рослини негайно переносили в зволожувальну камеру в теплиці. Через 6 днів культивуції при 20-24°C та відносній вологості, що дорівнює близько 100%, ступінь впливу грибків на листки візуально оцінювали як % ураженої площі листків.

В цьому досліді рослини, які були оброблені 250млн.ч. сполук I-21, I-25, I-28, I-43, I-45, I-91, I-94 та I-97, відповідно, показали інфікованість не більше, ніж 10%, у той час як необроблені рослини були інфіковані на до 90%.