



УКРАЇНА

(19) UA (11) 81924 (13) C2

(51) МПК (2006)

C07D 277/56 (2006.01)

A01N 43/78 (2006.01)

A01P 3/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД(54) ТІАЗОЛІЛБІФЕНІЛАМІДИ, ЗАСІБ ТА ЇХ ЗАСТОСУВАННЯ ДЛЯ БОРОТЬБИ ІЗ НЕБАЖАНИМИ
МІКРООРГАНІЗМАМИ

1

2

(21) а200504319

(22) 26.09.2003

(24) 25.02.2008

(86) РСТ/ЕР2003/010758, 26.09.2003

(31) 102 46 959.8

(32) 09.10.2002

(33) DE

(72) ДУНКЕЛЬ РАЛЬФ, ЕЛЬБЕ ХАНС-ЛЮДВІГ,
РІКК ХАЙКО, DE/FR, ВАХЕНДОРФ-НОЙМАНН
УЛЬРІКЕ, КУКК КАРЛ-ХАЙНЦ

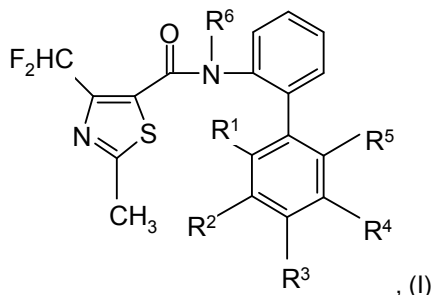
(73) БАЕР КРОПСАЄНС АГ

(56) WO 02059086, A, 01.08.2002

EP 0 545 099, A, 09.06.1993

UA 20040907251, A, 15.10.2004

(57) 1. Тіазолілбіфеніламіди формули (I)



, (I)

в якій

R¹, R², R³, R⁴ та R⁵ незалежно один від одного означають водень, галоген або C₁-C₆-алкіл, R⁶ означає C₁-C₈-алкіл або -COR⁷, R⁷ означає водень, C₁-C₈-алкіл, C₁-C₈-алкокси, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл або 4-(дифторметил)-2-метил-1,3-тіазол-2-іл.

2. Тіазолілбіфеніламіди формули (I) за п. 1, в якій R¹, R², R³, R⁴ та R⁵ незалежно один від одного означають водень, фтор, хлор, бром, метил, етил, н- або ізопропіл, н-, ізо-, втор- або трет-бутил, R⁶ означає C₁-C₆-алкіл або -COR⁷, R⁷ означає водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₃-алкокси-C₁-C₃-алкіл або 4-(дифторметил)-2-метил-1,3-тіазол-2-іл.

3. Тіазолілбіфеніламіди формули (I) за п. 1, в якій R¹, R², R³, R⁴ та R⁵ незалежно один від одного означають водень, фтор, хлор, бром або метил,

R⁶ означає метил, етил, н- або ізопропіл, н-, ізо-, втор- або трет-бутил, пентил або гексил або -COR⁷,

R⁷ означає водень, метил, етил, н- або ізопропіл, трет-бутил, метокси, етокси, трет-бутоксид або 4-(дифторметил)-2-метил-1,3-тіазол-2-іл.

4. Тіазолілбіфеніламіди формули (I) за п. 1, в якій відповідно чотири із залишків R¹, R², R³, R⁴ та R⁵ означають водень.

5. Тіазолілбіфеніламіди формули (I) за п. 1, в якій R¹, R², R⁴ та R⁵ відповідно означають водень та R³ має вказані в одному із пп. 1-3 значення.

6. Тіазолілбіфеніламіди формули (I) за п. 1, в якій R², R⁴ та R⁵ відповідно означають водень та R¹ та R³ незалежно один від одного мають вказані в одному із пп. 1-3 значення.

7. Тіазолілбіфеніламіди формули (I) за п. 1, в якій R¹, R⁴ та R⁵ відповідно означають водень та R² та R³ незалежно один від одного мають вказані в одному із пп. 1-3 значення.

8. Тіазолілбіфеніламіди формули (I) за п. 1, в якій R¹, R³ та R⁵ відповідно означають водень та R² та R⁴ незалежно один від одного мають вказані в одному із пп. 1-3 значення.

9. Тіазолілбіфеніламіди формули (I) за п. 1, в якій R⁶ означає -COR⁷ та R⁷ означає 4-(дифторметил)-2-метил-1,3-тіазол-2-іл.

10. Тіазолілбіфеніламіди формули (I) за п. 1, в якій R⁶ означає -COR⁷ та R⁷ означає метил, етил, зокрема метил.

11. Тіазолілбіфеніламіди формули (I) за п. 1, в якій R⁶ означає -CHO.

12. Тіазолілбіфеніламіди формули (I) за п. 1, в якій R⁶ означає метил, етил, н- або ізопропіл, н-, ізо-, втор- або трет-бутил, зокрема метил або ізопропіл.

13. Засіб для боротьби із небажаними мікроорганізмами, який відрізняється тим, що містить щонайменше один тіазолілбіфеніламід формули (I) за п. 1 поряд із розріджувачами та/або поверхнево-активними речовинами.

14. Застосування тіазолілбіфеніламідів формули (I) за п. 1 для боротьби з небажаними мікроорганізмами.

(13) C2

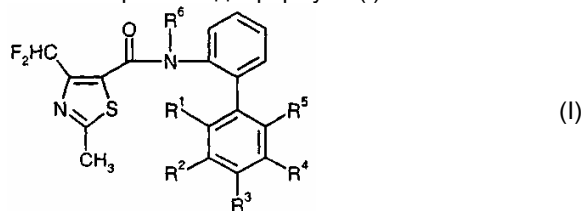
(11) 81924

(19) UA

Даний винахід стосується нових тiazолілбіфеніламідів, кількох способів їх одержання та їх застосування для боротьби зі шкідливими мікроорганізмами в області захисту рослин та матеріалів.

Відомо, що численні карбоксаніліди проявляють фунгіцидні властивості [див., наприклад, EP 0 545 099]. Активність описаних там речовин є високою, але при незначних витратних кількостях у деяких випадках незадовільною.

Нещодавно були описані нові тiazолілбіфеніламідні формули (I)



в якій R^1, R^2, R^3, R^4 та R^5 незалежно один від одного означають водень, галоген, ціано, нітро, C_1-C_6 -алкіл, C_2-C_6 -алкеніл, C_1-C_4 -алкокси, C_1-C_4 -алкілтіо, C_1-C_4 -алкілсульфоніл, C_3-C_6 -циклоалкіл, або C_1-C_4 -галогеналкіл, C_1-C_4 -галогеналкокси, C_1-C_4 -галогеналкілтіо або C_1-C_4 -галогеналкілсульфоніл, які містять відповідно від 1 до 5 атомів галогену,

R^1 та R^2 або R^2 та R^3 крім того разом означають, в разі необхідності, заміщений галогеном або C_1-C_6 -алкілом алкенілен,

R^6 означає C_1-C_8 -алкіл, C_1-C_6 -алкілсульфініл, C_1-C_6 -алкілсульфоніл, C_1-C_4 -алкокси- C_1-C_4 -алкіл, C_3-C_8 -циклоалкіл; C_1-C_6 -галогеналкіл, C_1-C_4 -галогеналкілсульфаніл, C_1-C_4 -галогеналкілсульфініл, C_1-C_4 -галогеналкілсульфоніл, галоген- C_1-C_4 -алкокси- C_1-C_4 -алкіл, C_3-C_8 -галогенциклоалкіл, що містять відповідно від 1 до 9 атомів фтору, хлору та/або бром; $-COR^7$, $-CONR^8R^9$ або $-CH_2NR^{10}R^{11}$,

R^7 означає водень, C_1-C_8 -алкіл, C_1-C_8 -алкокси, C_1-C_4 -алкокси- C_1-C_4 -алкіл, C_3-C_8 -циклоалкіл; C_1-C_6 -галогеналкіл, C_1-C_6 -галогеналкокси, галоген- C_1-C_4 -алкокси- C_1-C_4 -алкіл, C_3-C_8 -галогенциклоалкіл, що містять відповідно від 1 до 9 атомів фтору, хлору та/або бром, або 4-(дифторметил)-2-метил-1,3-тіазол-2-іл,

R^8 та R^9 незалежно один від одного означають водень, C_1-C_8 -алкіл, C_1-C_4 -алкокси- C_1-C_4 -алкіл, C_3-C_8 -циклоалкіл; C_1-C_8 -галогеналкіл, галоген- C_1-C_4 -алкокси- C_1-C_4 -алкіл, C_3-C_8 -галогенциклоалкіл, що містять відповідно від 1 до 9 атомів фтору, хлору та/або бром,

R^8 та R^9 крім того разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють, в разі необхідності, один або кілька разів однаково або по-різному заміщений галогеном або C_1-C_4 -алкілом насичений гетероцикл, що містить від 5 до 8 атомів кільця, причому гетероцикл може містити 1 або 2 інших несусідніх гетероатомів з ряду кисень, сірка або NR^{12} ,

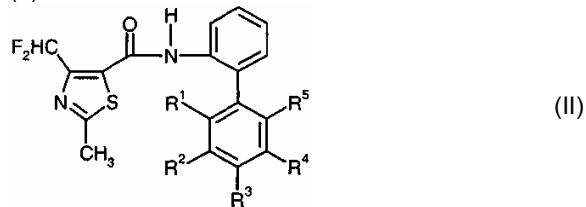
R^{10} та R^{11} незалежно один від одного означають водень, C_1-C_8 -алкіл, C_3-C_8 -циклоалкіл; C_1-C_8 -галогеналкіл, C_3-C_8 -галогенциклоалкіл, що містять відповідно від 1 до 9 атомів фтору, хлору та/або бром,

R^{10} та R^{11} крім того разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють, в разі необхідності, один або кілька разів однаково або по-різному заміщений галогеном або C_1-C_4 -алкілом насичений гетероцикл, що містить від 5 до 8 атомів кільця, причому гетероцикл може містити 1 або 2 інших несусідніх гетероатомів з ряду кисень, сірка або NR^{12} ,

R^{12} означає водень або C_1-C_6 -алкіл.

З'ясували також, що тiazолілбіфеніламідні формули (I) одержують шляхом

(A) взаємодії тiazолілбіфеніламідів формули (II)



в якій R^1, R^2, R^3, R^4 та R^5 мають вказані вище значення,

з галогенідом формули (III)

R^6-X (III)

в якій

R^6 має вказані вище значення та

X означає хлор, бром або йод,

в присутності основи та в присутності розріджувача.

Крім того з'ясували, що нові тiazолілбіфеніламідні формули (I) проявляють дуже високі мікробіцидні властивості та можуть бути застосовані для боротьби з небажаними мікроорганізмами, а також в області захисту рослин та матеріалів.

Несподівано з'ясували, що тiazолілбіфеніламідні формули (I) згідно з винаходом проявляють значно кращу фунгіцидну активність, ніж подібні за структурою відомі до цього часу активні речовини такого ж напрямку дії.

Тiazолілбіфеніламідні згідно з винаходом характеризуються загальною формулою (I). Нижче наведені переважні визначення замісників у вказаних вище та нижче формулах. Вони також стосуються попередніх та проміжних продуктів.

R^1, R^2, R^3, R^4 та R^5 незалежно один від одного означають переважно водень, фтор, хлор, бром, ціано, нітро, метил, етил, n- або ізо-пропіл, n-, ізо-, втор- або трет-бутил, метокси, етокси, метилтіо, етилтіо, n- або ізо-пропілтіо, циклопропіл, трифторметил, трихлорметил, трифторетил, дифторметокси, трифторметокси, дифторхлорметокси, трифторетокси,

дифторметилтіо, дифторхлорметилтіо або трифторметилтіо.

R^1 та R^2 або R^2 та R^3 крім того разом означають переважно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором, бромом або метилом бутадієн-дііл.

R^6 означає переважно C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_4 -алкілсульфініл, C_1 - C_4 -алкілсульфоніл, C_1 - C_3 -алкокси- C_1 - C_3 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл; C_1 - C_4 -галогеналкіл, C_1 - C_4 -галогеналкілсульфаніл, C_1 - C_4 -галогеналкілсульфініл, C_1 - C_4 -галогеналкілсульфоніл, галоген- C_1 - C_3 -алкокси- C_1 - C_3 -алкіл, C_3 - C_6 -галогенциклоалкіл, що містять відповідно від 1 до 9 атомів фтору, хлору та/або бромів; $-COR^1$, $-CONR^8R^9$ або $-CH_2NR^{10}R^{11}$.

R^7 означає переважно водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_3 -алкокси- C_1 - C_3 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл; C_1 - C_4 -галогеналкіл, C_1 - C_4 -галогеналкокси, галоген- C_1 - C_3 -алкокси- C_1 - C_3 -алкіл, C_3 - C_6 -галогенциклоалкіл, що містять відповідно від 1 до 9 атомів фтору, хлору та/або бромів, або 4-(дифторметил)-2-метил-1,3-тіазол-2-іл.

R^8 та R^9 незалежно один від одного означають переважно водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_3 -алкокси- C_1 - C_3 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл; C_1 - C_4 -галогеналкіл, галоген- C_1 - C_3 -алкокси- C_1 - C_3 -алкіл, C_3 - C_6 -галогенциклоалкіл, що містять відповідно від 1 до 9 атомів фтору, хлору та/або бромів.

R^8 та R^9 крім того разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють переважно, в разі необхідності, 1-4 рази однаково або по-різному заміщений галогеном або C_1 - C_4 -алкілом насичений гетероцикл, що містить від 5 до 8 атомів кільця, причому гетероцикл може містити 1 або 2 інших несусідніх гетероатомів з ряду кисень, сірка або NR^{12} .

R^{10} та R^{11} незалежно один від одного означають переважно водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл; C_1 - C_4 -галогеналкіл, C_3 - C_6 -галогенциклоалкіл, що містять відповідно від 1 до 9 атомів фтору, хлору та/або бромів.

R^{10} та R^{11} крім того разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють переважно, в разі необхідності, один або кілька разів однаково або по-різному заміщений галогеном або C_1 - C_4 -алкілом насичений гетероцикл, що містить від 5 до 8 атомів кільця, причому гетероцикл може містити 1 або 2 інших несусідніх гетероатомів з ряду кисень, сірка або NR^{12} .

R^{12} означає переважно водень або C_1 - C_4 -алкіл.

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 незалежно один від одного означають особливо переважно водень, фтор, хлор, бром, ціано, метил, метокси, метилтіо, трифторметил, дифторметокси, трифторметокси, дифторметилтіо або трифторметилтіо.

R^6 означає особливо переважно метил, етил, н- або ізо-пропіл, н-, ізо-, втор- або трет-бутил, пентил або гексил, метилсульфініл, етилсульфініл, н- або ізо-пропілсульфініл, н-, ізо-, втор- або трет-бутилсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл, н- або ізо-пропілсульфоніл, н-, ізо-, втор- або трет-бутилсульфоніл, метоксиметил, метоксиетил, етоксиметил, етоксиетил, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, трифторметил, трихлорметил, трифторетил,

дифторметилсульфаніл, дифторхлорметилсульфаніл, трифторметилсульфаніл, трифторметилсульфініл, трифторметилсульфоніл, трифторметоксиметил; $-COR^7$, $-CONR^8R^9$ або $-CH_2NR^{10}R^{11}$.

R^7 означає особливо переважно водень, метил, етил, н- або ізо-пропіл, трет-бутил, метокси, етокси, трет-бутокс, циклопропіл; трифторметил, трифторметокси або 4-(дифторметил)-2-метил-1,3-тіазол-2-іл.

R^8 та R^9 незалежно один від одного означають особливо переважно водень, метил, етил, н- або ізо-пропіл, н-, ізо-, втор- або трет-бутил, метоксиметил, метоксиетил, етоксиметил, етоксиетил, циклопропіл, циклопентил, циклогексил; трифторметил, трихлорметил, трифторетил, трифторметоксиметил.

R^8 та R^9 крім того разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють особливо переважно, в разі необхідності, 1-4 рази однаково або по-різному заміщений фтором, хлором, бромом або метилом насичений гетероцикл з ряду морфолін, тіоморфолін або піперазин, причому піперазин в другому положенні може бути заміщений R^{12} .

R^{10} та R^{11} незалежно один від одного означають особливо переважно водень, метил, етил, н- або ізо-пропіл, н-, ізо-, втор- або трет-бутил, метоксиметил, метоксиетил, етоксиметил, етоксиетил, циклопропіл, циклопентил, циклогексил; трифторметил, трихлорметил, трифторетил, трифторметоксиметил.

R^{10} та R^{11} крім того разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють особливо переважно, в разі необхідності, 1-4 рази однаково або по-різному заміщений фтором, хлором, бромом або метилом насичений гетероцикл з ряду морфолін, тіоморфолін або піперазин, причому піперазин у другому положенні може бути заміщений R^{12} .

R^{12} означає особливо переважно водень, метил, етил, н- або ізо-пропіл, н-, ізо-, втор- або трет-бутил.

Найбільшу перевагу надають тіазолілбіфеніламідам формули (I), в якій кожен із чотирьох залишків R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 означає водень.

Найбільшу перевагу надають тіазолілбіфеніламідам формули (I), якій R^1 , R^2 , R^4 та R^5 означають відповідно водень та

R^3 має вказані вище значення.

Найбільшу перевагу надають тіазолілбіфеніламідам формули (I), в якій R^1 , R^2 , R^4 та R^5 означають відповідно водень та

R^3 означає фтор, хлор, бром, метил, трифторметил, трифторметокси або трифторметилтіо.

Найбільшу перевагу надають тіазолілбіфеніламідам формули (I), в якій R^2 , R^4 та R^5 означають відповідно водень та R^1 та R^3 незалежно один від одного мають вказані вище значення.

Найбільшу перевагу надають тіазолілбіфеніламідам формули (I), в якій

R^2 , R^4 та R^5 означають відповідно водень та R^1 та R^3 незалежно один від одного означають фтор, хлор, бром, метил або трифторметил.

Найбільшу перевагу надають тiazолілбіфеніламідам формули (I), в якій R^1 , R^4 та R^5 означають відповідно водень та R^2 та R^3 незалежно один від одного мають вказані вище значення.

Найбільшу перевагу надають тiazолілбіфеніламідам формули (I), в якій R^1 , R^4 та R^5 означають відповідно водень та R^2 та R^3 незалежно один від одного означають фтор, хлор, бром, метил або трифторметил.

Найбільшу перевагу надають тiazолілбіфеніламідам формули (I), в якій R^1 , R^3 та R^5 означають відповідно водень та R^2 та R^4 незалежно один від одного мають вказані вище значення.

Найбільшу перевагу надають тiazолілбіфеніламідам формули (I), в якій R^1 , R^3 та R^5 означають відповідно водень та R^2 та R^4 незалежно один від одного означають фтор, хлор, бром, метил або трифторметил.

Найбільшу перевагу надають тiazолілбіфеніламідам формули (I), в якій R^6 означає $-\text{COR}^7$, а R^7 означає 4-(дифторметил)-2-метил-1,3-тіазол-2-іл.

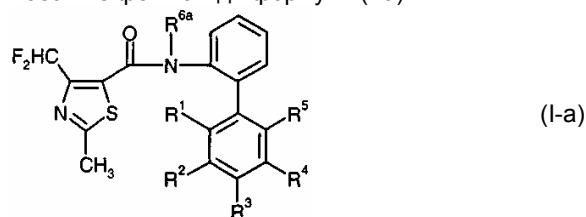
Найбільшу перевагу надають тiazолілбіфеніламідам формули (I), в якій R^6 означає $-\text{COR}^7$, а R^7 означає метил, етил, циклопропіл або трифторметил, зокрема метил.

Найбільшу перевагу надають тiazолілбіфеніламідам формули (I), в якій R^6 означає $-\text{CHO}$.

Найбільшу перевагу надають тiazолілбіфеніламідам формули (I), в якій R^6 означає метил, етил, n- або ізо-пропіл, n-,

ізо-, втор- або трет-бутил, метилсульфініл, метилсульфоніл, метоксиметил, етоксиметил, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, трифторметил, трихлорметил, трифторметилсульфаніл, трифторметилсульфініл, трифторметилсульфоніл, трифторметоксиметил, зокрема метил, ізо-пропіл або циклопропіл.

До переважної групи належать тiazолілбіфеніламіди формули (I-a)



в якій R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 незалежно один від одного означають водень, галоген, ціано, нітро, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -алкіл, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -алкеніл, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкокси, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкілтіо, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкілсульфоніл, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -циклоалкіл, або $\text{C}_1\text{-C}_4$ -галогеналкіл, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -галогеналкокси, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -галогеналкілтіо або $\text{C}_1\text{-C}_4$ -галогеналкілсульфоніл, що містять відповідно від 1 до 5 атомів галогену,

R^1 та R^2 або R^2 та R^3 крім того разом означають, в разі необхідності, заміщений галогеном або $\text{C}_1\text{-C}_6$ -алкілом алкенілен,

R^{6a} означає $\text{C}_1\text{-C}_8$ -алкіл, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -алкілсульфініл, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -алкілсульфоніл, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкокси- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкіл, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -циклоалкіл; $\text{C}_1\text{-C}_6$ -галогеналкіл, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -галогеналкілсульфаніл, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -галогеналкілсульфініл, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -галогеналкілсульфоніл, галоген- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкокси- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкіл, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -галогенциклоалкіл, що містять відповідно від 1 до 9 атомів фтору, хлору та/або бром; $-\text{COR}^{7a}$, $-\text{CONR}^8\text{R}^9$ або $-\text{CH}_2\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$,

R^{7a} означає водень, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -циклоалкіл; $\text{C}_3\text{-C}_8$ -галогенциклоалкіл, що містять відповідно від 1 до 9 атомів фтору, хлору та/або бром; або 4-(дифторметил)-2-метил-1,3-тіазол-2-іл,

R^8 та R^9 незалежно один від одного означають водень, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -алкіл, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкокси- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкіл, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -циклоалкіл; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -галогеналкіл, галоген- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкокси- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкіл, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -галогенциклоалкіл, що містять відповідно від 1 до 9 атомів фтору, хлору та/або бром.

R^8 та R^9 крім того разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють, в разі необхідності, один або кілька разів однаково або по-різному заміщений галогеном або $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкілом насичений гетероцикл, що містить від 5 до 8 атомів кільця,

причому гетероцикл може містити 1 або 2 інших несусідніх гетероатомів з ряду кисень, сірка або NR^{12} ,

R^{10} та R^{11} незалежно один від одного означають водень, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -алкіл, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -циклоалкіл; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -галогеналкіл, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -галогенциклоалкіл, що містять відповідно від 1 до 9 атомів фтору, хлору та/або бром.

R^{10} та R^{11} крім того разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють, в разі необхідності, один або кілька разів однаково або по-різному заміщений галогеном або $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкілом насичений гетероцикл, що містить від 5 до 8 атомів кільця, причому гетероцикл може містити 1 або 2 інших несусідніх гетероатомів з ряду кисень, сірка або NR^{12} ,

R^{12} означає водень або $\text{C}_1\text{-C}_6$ -алкіл.

Тiazолілбіфеніламіди згідно з винаходом характеризуються загальною формулою (I-a). Нижче наведені переважні визначення вказаних в цій формулі замісників.

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^9 , R^{10} , R^{11} та R^{12} незалежно один від одного переважно, особливо переважно або найбільш переважно мають значення, вказані при описі речовин формули (I) згідно з винаходом та визначені як переважні, особливо переважні або найбільш переважні для цих залишків.

R^{6a} означає переважно $\text{C}_1\text{-C}_6$ -алкіл, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкілсульфініл, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкілсульфоніл, $\text{C}_1\text{-C}_3$ -алкокси- C_1 -алкіл, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -циклоалкіл; $\text{C}_1\text{-C}_4$ -галогеналкіл, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -галогеналкілсульфаніл, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -галогеналкілсульфініл, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -галогеналкілсульфоніл, галоген- $\text{C}_1\text{-C}_3$ -алкокси- C_1 -алкіл, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -галогенциклоалкіл, що містять відповідно від 1 до 9 атомів фтору, хлору та/або бром; $-\text{COR}^{7a}$, $-\text{CONR}^8\text{R}^9$ або $-\text{CH}_2\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$.

R^{7a} означає переважно водень, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -циклоалкіл; $\text{C}_3\text{-C}_6$ -галогенциклоалкіл, що містить відповідно від 1 до 9 атомів фтору, хлору та/або

брому, або 4-(дифторметил)-2-метил-1,3-тіазол-2-іл.

R^{6a} означає особливо переважно метил, етил, н- або ізо-пропіл, н-, ізо-, втор- або трет-бутил, пентил або гексил, метилсульфініл, етилсульфініл, н- або ізо-пропілсульфініл, н-, ізо-, втор- або трет-бутилсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл, н- або ізо-пропілсульфоніл, н-, ізо-, втор- або трет-бутилсульфоніл, метоксиметил, метоксиетил, етоксиметил, етоксиетил, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, трифторметил, трихлорметил, трифторетил, дифторметилсульфаніл, дифторхлорметилсульфаніл, трифторметилсульфаніл, трифторметилсульфініл, трифторметилсульфоніл, трифторметоксиметил; $-COR^{7a}$, $-CONR^8R^9$ або $-CH_2NR^{10}R^{11}$.

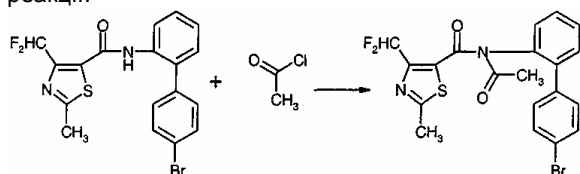
R^7 означає особливо переважно водень, циклопропіл або 4-(дифторметил)-2-метил-1,3-тіазол-2-іл.

Крім того перевагу надають тіазолілбифеніламідам формули (I-a), в якій R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 неодноразово означають водень.

Крім того перевагу надають тіазолілбифеніламідам формули (I-a), в якій R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 мають вказані вище значення, але не означають галоген.

Крім того перевагу надають тіазолілбифеніламідам формули (I-a), в якій R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 неодноразово означають водень та крім того незалежно один від одного не означають галоген.

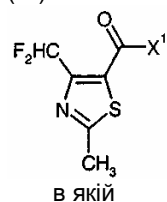
Якщо як вихідні речовини застосовують N-(4'-бром-1,1'-бифеніл-2-іл)-4-(дифторметил)-2-метил-1,3-тіазол-5-карбоксамід та ацетилхлорид, то здійснення способу (A) згідно з винаходом можна продемонструвати за допомогою такого рівняння реакції:



Тіазолілбифеніламіди, які як вихідні речовини необхідні для здійснення способу (A) згідно з винаходом, загалом характеризуються формулою (II). В цій формулі R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 переважно, особливо переважно або найбільш переважно мають значення, вказані при описі речовин формули (I) згідно з винаходом та визначені як переважні, особливо переважні або найбільш переважні для цих залишків.

Тіазолілбифеніламіди формули (II) описані в [DE-A 102 04 391]. Вони можуть бути одержані шляхом

а) взаємодії галогенідів дифторметилтіазолілкарбонової кислоти формули (IV)



(IV)

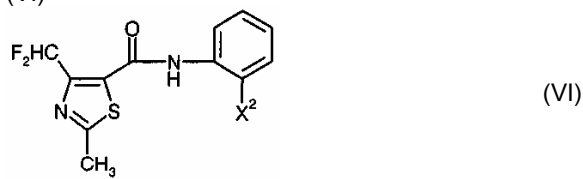
X^1 означає галоген, з похідними аніліну формули (V)



(V)

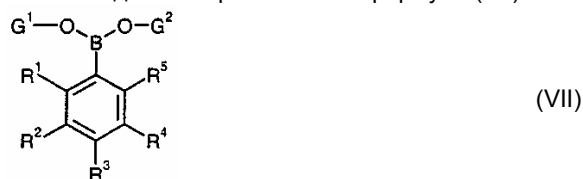
в якій R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 має вказані вище значення, в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоту, (наприклад, триетиламіну) та, в разі необхідності, в присутності розріджувача (наприклад, тетрагідрофурану), або

б) взаємодії дифторметилтіазолілкарбокsgалогенідів формули (VI)



(VI)

в якій X^2 означає бром або йод, з похідними борної кислоти формули (VII)



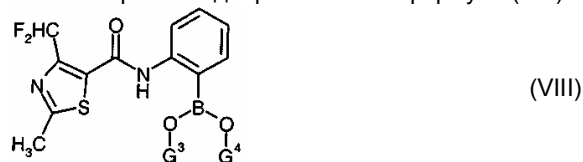
(VII)

в якій R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 мають вказані вище значення,

G^1 та G^2 означають відповідно водень або разом означають тетраметилетилен,

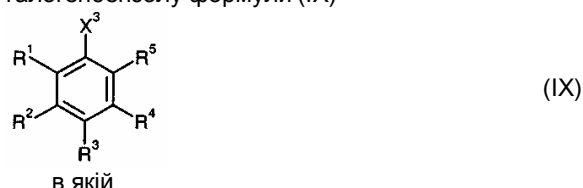
в присутності каталізатора (наприклад, хлориду 1,1'-біс(дифенілфосфіно)-фероценпаладію(II)), в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоту, (наприклад, ацетату калію) та, в разі необхідності, в присутності розріджувача (наприклад, диметилсульфоксиду), або

с) взаємодії похідних тіазолілбифеніламідборної кислоти формули (VIII)



(VIII)

в якій G^3 та G^4 відповідно означають водень або разом означають тетраметилетилен, з похідними галогенбензолу формули (IX)



(IX)

в якій

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 мають вказані вище значення,
 X^3 означає бром, йод або трифторметилсульфонілокси,

в присутності каталізатора (наприклад, хлориду 1,1'-біс(дифенілфосфіно)-фероценпаладію(II)), в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоту, (наприклад, ацетату калію) та, в разі необхідності, в присутності розріджувача (наприклад, диметилсульфоксиду).

Галогеніди диформетилтіазолілкарбонової кислоти, які як вихідні речовини необхідні для здійснення способу а) згідно з винаходом, загалом характеризуються формулою (IV). В цій формулі (IV) X^1 переважно означає хлор.

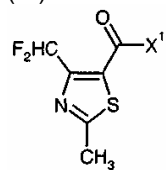
Галогеніди диформетилтіазолілкарбонової кислоти формули (IV) відомі та/або можуть бути одержані відомими способами [див., наприклад, EP 0 276 177].

Аніліни, які як вихідні речовини також необхідні для здійснення способу а) згідно з винаходом, загалом характеризуються формулою (V). В цій формулі (V) R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 переважно, особливо переважно або найбільш переважно мають значення, вказані при описі сполук формули (I) згідно з винаходом та визначені як переважні, особливо переважні або найбільш переважні для цих залишків.

Похідні аніліну формули (V) відомі та/або можуть бути одержані відомими методами [див., наприклад, Bull. Korean Chem. Soc. 2000. 21, 165-166; Chem. Pharm. Bull. 1992, 40, 240-4; JP 09132567].

Диформетилтіазолілкарбоксгалогенаніліди, які як вихідні речовини необхідні для здійснення способу б) згідно з винаходом, загалом характеризуються формулою (VI). В цій формулі (VI) X^2 означає переважно бром або йод.

Диформетилтіазолілкарбоксгалогенаніліди формули (VI) можуть бути одержані шляхом д) взаємодії галогенідів диформетилтіазолілкарбонової кислоти формули (IV)



(IV)

в якій
 X^1 означає галоген,
 з 2-броманіліном або 2-йоданіліном.

Галогеніди диформетилтіазолілкарбонової кислоти формули (IV), які як вихідні речовини необхідні для здійснення способу d) згідно з винаходом, були описані вище при описі способу а) згідно з винаходом.

Речовини 2-броманілін або 2-йоданілін, які як вихідні речовини необхідні для здійснення способу d) згідно з винаходом є відомими хімічними речовинами синтезу.

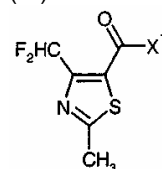
Похідні борної кислоти, які як вихідні речовини також необхідні для здійснення способу b) згідно з винаходом, загалом характеризуються формулою (VII). В цій формулі (VII) R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5

переважно, особливо переважно або найбільш переважно мають значення, вказані при описі сполук формули (I) згідно з винаходом та визначені як переважні, особливо переважні або найбільш переважні для цих залишків. G^1 та G^2 означають переважно відповідно водень або разом означають тетраметилетилен.

Похідні борної кислоти формули (VII) є відомими хімічними речовинами синтезу. Вони можуть бути одержані безпосередньо перед реакцією із похідних галогенбензолу та естерів борної кислоти та без обробки використовуватися у подальших реакціях обміну (див. також приклади одержання).

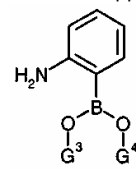
Похідні тіазолілбіфеніламідборної кислоти, які як вихідні речовини необхідні для здійснення способу с) згідно з винаходом, загалом характеризуються формулою (VIII). В цій формулі (VIII) G^3 та G^4 означають переважно відповідно водень або разом означають тетраметилетилен.

Похідні тіазолілбіфеніламідборної кислоти формули (VIII) можуть бути одержані шляхом е) взаємодії галогенідів диформетилтіазолілкарбонової кислоти формули (IV)



(IV)

в якій
 X^1 означає галоген,
 з похідними анілінборної кислоти формули (X)



(X)

в якій
 G^3 та G^4 мають вказані вище значення,
 в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоту, та, в разі необхідності, в присутності розріджувача.

Галогеніди диформетилтіазолілкарбонової кислоти формули (IV), які як вихідні речовини необхідні для здійснення способу е) згідно з винаходом, були описані вище при описі способу а) згідно з винаходом.

Похідні анілінборної кислоти, які як вихідні речовини також необхідні для здійснення способу е) згідно з винаходом, загалом характеризуються формулою (X). В цій формулі (X) G^3 та G^4 означають переважно відповідно водень або разом означають тетраметилетилен.

Похідні анілінборної кислоти формули (X), які як вихідні речовини необхідні для здійснення способу е) згідно з винаходом, є відомими хімічними речовинами синтезу.

Похідні галогенбензолу, які як вихідні речовини також необхідні для здійснення способу с) згідно з винаходом, загалом характеризуються формулою (IX). В цій формулі (IX) R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 переважно, особливо переважно або найбільш переважно мають значення, вказані при описі

сполук формули (I) згідно з винаходом та визначені як переважні, особливо переважні або найбільш переважні для цих залишків. X^3 означає переважно бром, йод або трифторметилсульфонілоксид.

Галогеніди, які як вихідні речовини також необхідні для здійснення способу (A) згідно з винаходом, загалом характеризуються формулою (III). В цій формулі R^6 переважно, особливо переважно або найбільш переважно має значення, вказані при описі сполук формули (I) згідно з винаходом та визначені як переважні, особливо переважні або найбільш переважні для цих залишків. X означає переважно хлор або бром.

Галогеніди формули (III) є відомими хімічними речовинами синтезу.

Як розріджувач для здійснення способу (A) згідно з винаходом застосовують всі інертні органічні розчинники. До них належать переважно аліфатичні, аlicиклічні або ароматичні вуглеводні, такі як, наприклад, петролейний етер, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол або декалін; галогеновані вуглеводні, такі як, наприклад, хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ, тетрахлорметан, дихлоретан або трихлоретан; етери, такі як діетиловий етер, діізопропіловий етер, метил-трет-бутиловий етер, метил-трет-аміловий етер, діоксан, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксиетан, 1,2-діетоксиетан або анізол або амід, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метилформанілід, N-метилпіролідон або триамід гексаметилфосфорної кислоти.

Спосіб (A) згідно з винаходом здійснюють, в разі необхідності, в присутності придатного акцептора кислоти. Як такі застосовують всі звичайні неорганічні або органічні основи. До них належать переважно гідриди, гідроксиди, амід, алколяти, ацетати, карбонати або гідрокарбонати лужноземельних або лужних металів, такі як, наприклад, гідрид натрію, амід натрію, метилат натрію, етилат натрію, трет-бутилат калію, гідроксид натрію, гідроксид калію, гідроксид амонію, ацетат натрію, ацетат калію, ацетат кальцію, ацетат амонію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат калію, гідрокарбонат натрію або карбонат цезію, а також третинні аміни, такі як триметиламін, триетиламін, трибутиламін, N,N-диметиланілін, N,N-диметилбензиламін, піридин, N-метилпіперидин, N-метилморфолін, N,N-диметиламінопіридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклононен (DBN) або діазабіциклоундецен (DBU).

Реакційні температури при здійсненні способу (A) згідно з винаходом можуть коливатися у широкому діапазоні. Загалом працюють при температурі від 0°C до 150°C, переважно при температурі від 20°C до 110°C.

При здійсненні способу (A) згідно з винаходом для одержання сполук формули (I) намоль тіазолілбенфеніламід формули (II) загалом застосовують від 0,2 до 5моль, переважно від 0,5 до 2моль галоген іду формули (III).

Як розріджувач для здійснення способів a), d) та e) згідно з винаходом застосовують всі інертні

органічні розчинники. До них належать переважно аліфатичні, аlicиклічні або ароматичні вуглеводні, такі як, наприклад, петролейний етер, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол або декалін; галогеновані вуглеводні, такі як, наприклад, хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ, тетрахлорметан, дихлоретан або трихлоретан; етери, такі як діетиловий етер, діізопропіловий етер, метил-трет-бутиловий етер, метил-трет-аміловий етер, діоксан, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксиетан, 1,2-діетоксиетан або анізол або амід, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метилформанілід, N-метилпіролідон або триамід гексаметилфосфорної кислоти.

Способи a), d) та e) згідно з винаходом, в разі необхідності, здійснюють в присутності придатного акцептора кислоти. Як такі застосовують всі звичайні неорганічні або органічні основи. До них належать переважно гідриди, гідроксиди, амід, алколяти, ацетати, карбонати або гідрокарбонати лужноземельних або лужних металів, такі як, наприклад, гідрид натрію, амід натрію, метилат натрію, етилат натрію, трет-бутилат калію, гідроксид натрію, гідроксид калію, гідроксид амонію, ацетат натрію, ацетат калію, ацетат кальцію, ацетат амонію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат калію, гідрокарбонат натрію або карбонат цезію, а також третинні аміни, такі як триметиламін, триетиламін, трибутиламін, N,N-диметиланілін, N,N-диметилбензиламін, піридин, N-метилпіперидин, N-метилморфолін, N,N-диметиламінопіридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклононен (DBN) або діазабіциклоундецен (DBU).

Реакційні температури при здійсненні способів a), d) та e) згідно з винаходом можуть коливатися у широкому діапазоні. Загалом працюють при температурі від 0°C до 150°C, переважно при температурі від 20°C до 110°C.

При здійсненні способу a) згідно з винаходом для одержання сполук формули (II) намоль галогеніду диформметилтіазолілкарбонової кислоти формули (IV) загалом застосовують від 0,2 до 5моль, переважно від 0,5 до 2моль похідної аніліну формули (V).

При здійсненні способу d) згідно з винаходом для одержання сполук формули (V) намоль галогеніду диформметилтіазолілкарбонової кислоти формули (IV) загалом застосовують від 0,2 до 5моль, переважно від 0,5 до 2моль 2-броманіліну або 2-йоданіліну.

При здійсненні способу e) згідно з винаходом для одержання сполук формули (VIII) намоль галогеніду диформметилтіазолілкарбонової кислоти формули (IV) загалом застосовують від 0,2 до 5моль, переважно від 0,5 до 2моль похідної анілінборної кислоти формули (X).

Як розріджувач для здійснення способів b) та c) згідно з винаходом застосовують всі інертні органічні розчинники. До них належать переважно аліфатичні, аlicиклічні або ароматичні вуглеводні, такі як, наприклад, петролейний етер, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол або декалін; етери, такі як

діетиловий етер, діізопропіловий етер, метил-трет-бутиловий етер, метил-трет-аміловий етер, діоксан, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксиетан, 1,2-діетоксиетан або анізол; нітрили, такі як ацетонітрил, пропіонітрил, *n*- або ізо-бутиронітрил або бензонітрил; амід, такі як *N,N*-диметилформамід, *N,N*-диметилацетамід, *N*-метилформанлід, *N*-метилпіролідон або триамід гексаметилфосфорної кислоти; естери, такі як метиловий естер оцтової кислоти або етиловий естер оцтової кислоти; сульфоксиди, такі як диметилсульфоксид; сульфони, такі як сульфолан; спирти, такі як метанол, етанол, *n*- або ізо-пропанол, *n*-, ізо-, втор-або трет-бутанол, етандіол, пропан-1,2-діол, етоксietанол, метоксиетанол, монометиловий етер діетиленгліколю, моноетиловий етер діетиленгліколю, їх суміші з водою або чиста вода.

Реакційні температури при здійсненні способів b) та c) згідно з винаходом можуть коливатися у широкому діапазоні. Загалом працюють при температурі від 0°C до 150°C, переважно при температурі від 20°C до 110°C.

Способи b) та c) згідно з винаходом, в разі необхідності, здійснюють в присутності придатного акцептора кислоти. Як такі застосовують всі звичайні неорганічні або органічні основи. До них належать переважно гідриди, гідроксиди, амід, алколяти, ацетати, Флориди, фосфати, карбонати або гідрокарбонати лужноземельних або лужних металів, такі як, наприклад, гідрид натрію, амід натрію, діізопропіламід літію, метилат натрію, етилат натрію, трет-бутилат калію, гідроксид натрію, гідроксид калію, ацетат натрію, фосфат натрію, фосфат калію, фторид калію, фторид цезію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат калію, гідрокарбонат натрію або карбонат цезію, а також третинні аміни, такі як триметиламін, триетиламін, трибутиламін, *N,N*-диметиланілін, *N,N*-диметилбензиламін, піридин, *N*-метилпіперидин, *N*-метилморфолін, *N,N*-диметиламінопіридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклононен (DBN) або діазабіциклоундецен (DBU).

Способи b) та c) згідно з винаходом здійснюють в присутності каталізатору, такого як, наприклад, паладієва сіль або паладієвий комплекс. Сюди належать переважно хлорид паладію, ацетат паладію, тетракіс-(трифенілфосфін)-паладій, хлорид біс-(трифенілфосфін)-паладію або хлорид (1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероценпаладію(II)).

В реакційній суміші може також утворюватися паладієвий комплекс, якщо при проведенні реакції до реакційної суміші окремо додають паладієву сіль та комплексний ліганд, такий як, наприклад, триетилфосфан, три-трет-бутилфосфан, трициклогексилфосфан, 2-(дициклогексилфосфан)біфеніл, 2-(ди-трет-бутилфосфан)-біфеніл, 2-(дициклогексилфосфан)-2'-(*N,N*-диметиламіно) біфеніл, трифенілфосфан, тріс-(*o*-толіл)фосфан, натрій-3-(дифенілфосфіно)бензолсульфонат, тріс-2-(метоксифеніл)-фосфан, 2,2'-біс-(дифенілфосфан)-1,1'-бінафтил, 1,4-біс-(дифенілфосфан)бутан, 1,2-біс-

(дифенілфосфан)етан, 1,4-біс-(дициклогексилфосфан)бутан, 1,2-біс-(дициклогексил-фосфан)етан, 2-(дициклогексилфосфан)-2'-(*N,N*-диметиламіно)біфеніл, біс-(дифенілфосфіно)фероцен або тріс-(2,4-трет-бутилфеніл)фосфіт.

При здійсненні способу b) згідно з винаходом для одержання сполук формули (II) намоль диформетилтіазолілкарбоксгалогенанілід формули (VI) загалом застосовують від 1 до 15моль, переважно від 2 до 8моль похідної борної кислот формули (VII).

При здійсненні способу c) згідно з винаходом для одержання сполук формули (II) намоль похідної тіазолілбіфеніламідборної кислоти формули (VI) загалом застосовують від 1 до 15моль, переважно від 2 до 8моль похідної галогенбензолу формули (IX).

Способи (A), a), b), c) та d) загалом здійснюють при нормальному тиску. Можливо також здійснювати їх при підвищеному або пониженому тиску, загалом працюють при тиску від 0,1 бардо 10бар.

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

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

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

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

види *Xanthomonas*, як, наприклад, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;

види *Pseudomonas*, як, наприклад, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;

види *Erwinia*, як, наприклад, *Erwinia amylovora*;

види *Pythium*, як, наприклад, *Pythium ultimum*;

види *Phytophthora*, як, наприклад, *Phytophthora infestans*;

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

види *Plasmopara*, як, наприклад, *Plasmopara viticola*;

види *Bremia*, як, наприклад *Bremia lactucae*;

види *Peronospora*, як, наприклад, *Peronospora pisi* або *P. brassicae*;

види *Erysiphe*, як, наприклад, *Erysiphe graminis*;

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

види *Podosphaera*, як, наприклад, *Podosphaera leucotricha*;

види *Venturia*, як, наприклад, *Venturia inaequalis*;

види *Pyrenophora*, як, наприклад, *Pyrenophora teres* або *P. graminea* (форма конідії: *Drechslera*, син.: *Helminthosporium*);

види *Cochliobolus*, наприклад, *Cochliobolus sativus* (форма конідії: *Drechslera*, син.: *Helminthosporium*);

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

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

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

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

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

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

види *Pyricularia*, наприклад, *Pyricularia oryzae*;

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

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

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

види *Leptosphaeria*, наприклад, *Leptosphaeria nodorum*;

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

види *Alternaria*, наприклад, *Alternaria brassicae*;

види *Pseudocercospora*, наприклад, *Pseudocercospora herpotrichoides*.

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

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

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

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

При цьому активні речовини згідно з винаходом особливо успішно можуть бути застосовані для боротьби із захворюваннями виноградних, фруктових та овочевих культур, наприклад, проти таких видів, як *Venturia*, *Botrytis*, *Sclerotinia*, *Rhizoctonia*, *Uncinula*, *Sphaerotheca*, *Podosphaera*, *Alternaria* та *Colletotrichum*. Із особливим успіхом активні речовини також застосовують у боротьбі із захворюваннями рису, наприклад, проти таких видів, як *Pyricularia* та *Pellicularia*.

Активні речовини згідно з винаходом придатні також для підвищення продуктивності врожаю.

Крім того вони є менш токсичними та проявляють високу сумісність з рослинами.

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

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

Згідно з винаходом обробку рослин та частин рослин активними речовинами здійснюють безпосередньо або шляхом впливу на їх оточення, середовище їх росту або закрите сховище відповідно до звичайних методів обробки, наприклад, шляхом занурення, мілкокрапельного обприскування, випару, створення штучного тумана, розкидання, намазування, впрорскування, а у випадку матеріалу для розмноження, особливо у випадку насіння, шляхом одношарового або багатшарового покриття.

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

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

деревині, лакофарбовим матеріалам, змазкам та рідким теплоносіям, особливо деревині.

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

Необхідно, наприклад, назвати мікроорганізми таких родів:

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

Staphylococcus, такі як *Staphylococcus aureus*.

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

Ці композиції одержують відомими способами, наприклад, змішуванням активних речовин з розріджувачами, тобто рідкими розчинниками, розрідженими газами під тиском та/або твердими носіями, в разі необхідності, при застосуванні поверхнево-активних речовин, тобто емульгаторів та/або диспергаторів та/або піноутворюючих речовин. У випадку використання води як розріджувача можуть також бути застосовані, наприклад, органічні розчинники як допоміжні засоби, що поліпшують розчинення. Як рідкі органічні розчинники в основному застосовують: ароматичні сполуки, такі як ксилол, толуол, або алкілнафталіни, хлоровані ароматичні сполуки або хлоровані аліфатичні вуглеводні, такі як хлорбензоли, хлоретилени або метиленхлорид, аліфатичні вуглеводні, такі як циклогексан або парафіни, наприклад, фракції нафти, спирти, такі як бутанол або гліколь, а також їх етери та естери, кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон або циклогексанон, сильнополярні розчинники, такі як диметилформамід та диметилсульфоксид, а також воду. Під розрідженими газоподібними розріджувачами або носіями розуміють такі рідини, які при нормальній температурі та нормальному тиску існують у формі газу, наприклад, аерозолі, такі як галогенвуглеводні, а також бутан, пропан, азот та діоксид вуглецю. Як тверді носії мають на увазі: наприклад, помели природних каменів, таких як каоліни, глиноземи, тальк, крейда, кварц,

атапульгіт, монтморилоніт або діатомова земля, та помели синтетичних каменів, такі як високодисперсна кремнієва кислота, оксид алюмінію та силікати. Як тверді носії для гранулятів мають на увазі: наприклад, подрібнені та фракціоновані природні кам'яні породи, такі як кальцит, мармур, пемза, сепіоліт, доломіт, а також синтетичні грануляти з неорганічного або органічного борошна, а також грануляти з органічного матеріалу, такого як тирса, шкарлупа кокосових горіхів, кукурудзяні качани та стебла тютюну. Як емульгатори та/або піноутворюючі засоби мають на увазі: наприклад, неіоногенні та аніонні емульгатори, такі як поліоксиетиленовий естер жирної кислоти, поліоксиетиленовий етер жирного спирту, наприклад, алкіларилполігліколевий етер, алкілсульфонати, алкілсульфати, арилсульфонати, а також гідролізати білку/ Як диспергуючі засоби мають на увазі: наприклад, відпрацьовані лігнінсульфітні луги та метилцеллюлозу.

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

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

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

Активні речовини згідно з винаходом можуть бути використані як такі або у своїй препаративній формі змішані з відомими фунгіцидами, бактерицидами, акарицидами, нематоцидами або інсектицидами, наприклад, з метою розширення спектру дії або запобігання розвитку резистентності. У багатьох випадках при цьому одержують синергічні ефекти, тобто ефективність суміші є вищою, ніж ефективність її окремих компонентів.

Для змішування використовують, наприклад, такі сполуки:

Фунгіциди:

2-фенілфенол; 8-гідроксихінолієсульфати;
ацибензолар-S-метил; алдиморф, амідифлумет;
ампропілфос; ампропілфос-калій; андоприм;
анілазини; азокназоли; азоксистробін;
беналаксил; беноданіл; беноміл;
бентіавалікарб-ізопропіл; бензамакріл;
бензамакріл-ізобутил; біланафос; бінапакрил;
біфеніл; бітертанол; бластицидин-S;
бромукназоли; бупіримати; бутіобати;
бутиламін;

полісульфіди кальцію; капсиміцин; каптафол;
каптан; карбендазім; карбоксин; карпропамід;

карвони; хінометіонат; хлорфеназоли; хлоронеб; хлороталоніл; хлорозолінати; хлоризакон; ціазофамід; цифлуфенамід; цимоксаніл; ципроконазоли; ципродиніл; ципрофурам;

Даггер G; дебакарб; дихлофлуанід; дихлони; дихлорофен; диклоцимет; дикломецини; диклоран; дієтофенкарб; дифеноконазоли; дифлуметорим; диметиримол; диметоморф; димоксистробін; диніконазоли; диніконазол-М; динокап; дифеніламіни; дипіритіони; диталіфос; дитіанон; додеморф; додини; дразоксолон;

едифенфос; епоксиконазоли; етабоксам; етиримол; етридіазолі;

фамоксидони; фенамідони; фенапаніл; фенаримол; фенбуконазоли; фенфурам; фенгексамід; фенітропан; феноксаніл; фенпиклоніл; фенпропідин; фенпропіморф; фербам; флуазинам; флугбензіміни; флудіоксоніл; флуметовер; флуморф; фторміди; флуоксастробін; флуоквіноконазоли; флурпримідол; флузілазоли; флусульфаміди; флутоланіл; флутріафол; фолпет; фозетил-алюміній; фозетил-натрій; фуберідазоли; фуралаксил; фураметпір; фуркарбоніл; фурмециклокс;

гуазатини; гексахлорбензоли; гексаконазоли; гімексозол;

імазаліл; імібенконазоли; іміноктадинтріацетати; іміноктадин-трис(альбесил); йодокарб; іпконазоли; іпробенфос; іпродіони; іпровалікарб; ірумаміцин; ізопротіолани; ізоваледіони;

казугаміцин; крезоксим-метил; манкозеб; манеб; меферимзоні; мепаніпірим; мепроніл; металаксил; металаксил-М; метконазоли; метасульфокарб; метфуроксам; метирам; метоміностробін; метсульфовакс; мілдіоміцин; миклобутаніл; миклозолін;

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

офурак; оризастробін; оксаксидил; оксалінова кислота; окспоконазоли; оксикарбоксин; оксифентії;

паклобутразол; пефуразоати; пенконазоли; пенцикурон; фосдифен; фталіди; піоксистеробін; піпералін; поліоксини; поліоксорим; пробеназоли; прохлораз; процимідони; пропамокарб; пропанозин-натрій; пропиконазоли; пропінеб; прохіназид; протіоконазоли; піраклостробін; піразофос; піріфенокс; піриметаніл; пірохілон; піроксифур; піролінітрини;

хінканазоли; хіноксифен; хінтоцени; симеконазоли; спіроксаміни; сульфур;

тебуконазоли; теклофталам; текназени; тетциклацис; тетраконазоли; тіабендазоли; тиціофен; тифлузаміди; тіофанат-метил; тирам; тіоксимід; толклофос-метил; толілфлуанід; триадимефон; триадименол; триазбутил; триазоксиди; трицикламіди; трициклазоли; тридеморф; трифлуксистеробін; трифлумізоли; трифорини; тритиконазоли;

уніконазоли; валідаміцин А; вінклозолін; зинеб; зирам; зоксаміди;

(2S)-N-[2-[4-[[3-(4-хлорфеніл)-2-пропініл]окс]-3-метоксифеніл]етил]-3-метил-2-[(метилсульфоніл)аміно]бутанамід;

1-(1-нафталеніл)-1Н-пірол-2,5-діон;
2,3,5,6-тетрахлор-4-(метилсульфоніл)піридин;
2-аміно-4-метил-N-феніл-5-тіазолкарбоксамід;
2-хлор-N-(2,3-дигідро-1,1,3-триметил-1Н-інден-4-іл)-3-піридинкарбоксамід;

3,4,5-трихлор-2,6-піридиндикарбонітрил;
актиновати;

цис-1-(4-хлорфеніл)-2-(1Н-1,2,4-тріазол-1-іл)циклогептанол;

метил-1-(2,3-дигідро-2,2-диметил-1Н-інден-1-іл)-1Н-імідазол-5-карбоксилат;

карбонат монокалію;

N-(6-метокси-3-піридиніл)циклопропанкарбоксамід;

N-бутил-8-(1,1-диметилетил)-1-

оксаспіро[4,5]декан-3-амін;

тетратіокарбонат натрію;

а також солі міді та сполуки із міді, такі як бордоска суміш; гідроксиди міді; нафтенати міді; оксихлориди міді; сульфати міді; куфранеб; оксиди міді; манкопер; оксин-мідь.

Бактерициди:

бронопол, дихлорофен, нітрапірин, нікель-диметилдитіокарбамат, касугаміцин, октилінон, фуранкарбонова кислота, окситетрациклін, пробеназол, стрептоміцин, теклофталам, сульфат міді та інші сполуки, що містять мідь.

Інсектициди/Акарициди/Нематоциди:

абамектин, ABG-9008, ацефати, ацехіноцил, ацетаміприд, ацетопроли, акринатрин, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, аланікарб, алдікарб, алдоксикарб, алетрин, IR-ізомери алетрину, альфа-циперметрин (альфаметрин), амідофлумет, амідокарб, амітраз, авермектин, AZ-60541, азадирахтин, азаметифос, азинфос-метил, азинфос-етил, азоциклотин,

Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Bacillus thuringiensis штам EG-2348, Bacillus thuringiensis штам GC-91, Bacillus thuringiensis штам NCTC-11821, Baculo віруси, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, бендіокарб, бенфуракарб, бенсультап, бензоксимати, бета-цифлутрин, бета-циперметрин, біфеназати, біфентрин, бінапакрил, біоалетрин, ізомер біоалетрин-Б-циклопентилу, біоетанометрин, біоперметрин, біоресметрин, бістріфлурон, BPMC, бромфенпрокс, бромфос-етил, бромпропілати, бромфенвінфос(-метил), BTG-504, BTG-505, буфенкарб, бупрофетин, бутатіофос, бутоксикарбоксим, бутоксикарбоксим, бутілпіридабен,

кадусафос, камфехлор, карбарил, карбофуран, карбофенотіон, карбосульфат, картап, CGA-50439, хінометіонат, хлордан, хлордимеформ, хлоетокарб, хлоретоксифос, хлорфенапір, хлорфенвінфос, хлофлуазурон, хлормефос, хлоробензилати, хлоропікрин, хлорпроксифен, хлорпірифос-метил, хлорпірифос(-етил), хловапортрин, хромафенозиди, цис-циперметрин, цис-ресметрин, цис-перметрин, клоцитрин, хлоетокарб, клофентезини, клотіанідин, клотіазобен, кодлемони, кумафос, ціанофенфос, ціанофос, циклопрени, циклопротрин, Cydia pomonella, цифлутрин, цигалотрин, цигексатин,

циперметрин, цифенотрин (1R-транс-ізомер),
циромацини,

DDT, дельтаметрин, деметон-Б-метил,
деметон-S-метилсульфон, діафентіурон, діаліфос,
діацінон, дихлофентіон, дихлорвос, дикофол,
дикротофос, дицикланіл, дифлубензурон,
диметоати, диметилвінфос, динобутон, динокап,
динотефуран, діофенолан, дисульфотон, докузат-
натрій, дофенапін, DOWCO-439,

ефлузиланати, емаектин, емаектин-
бензоати, емпентрин (1R-ізомер), ендосульфат,
Entomophthora spp., EPN, есфенвалерати,
етіофенкарб, етипроли, етіон, етопрофос,
етофенпрокс, етоксазоли, етримфос,

фамфур, фенаміфос, феназахін, фенбутатин
оксид, фенфлутрин, фенітротіон, фенобукарб,
фенотіокарб, феноксакрим, феноксикарб,
фенпропатрин, фенпірад, фенпіритрин,
фенпіроксимати, фенсульфотіон, фентіон,
фентрифаніл, фенвалерати, фіпроніл, флорікамід,
флуакупірім, флуазурон, флубеніміні,
флуброцитринати, флуциклоксурон,
флукітринати, флуфенерим, флуфеноксурон,
флуфенпрокс, флуметрин, флупіразофос,
флутензин (флуфензини), флувалінати, фонофос,
форметанати, формотіон, фосметилан,
фостіазати, фубфенпрокс (флупроксифен),
фуратіокарб,

гама-НСН, госиплури, грандлури,
гранулоподібні віруси,

галфенпрокс, галофенозиди, НСН, НСН-801,
гептенофос, гексафлумурон, гексилтіазокс,
гідраметиліони, гідропрени,

ІКА-2002, імідаклопрід, іміпротрин,
індоксакарб, йодофенфос, іпробенфос, ізазофос,
ізофенфос, ізопрокарб, ізоксатіон, івермектин,
японілури, кадетрин, віруси поліедроза,
кінопрени,

лямбда-цигалотрин, ліндани, луфенурон,
малатіон, мекарбам, месульфенфос,
метальдегід, метам-натрій, метакрифос,
метамідофос, Metharhizium anisopliae,
Metharhizium flavoviride, метидатіон, метіокарб,
метоміл, метопрени, метоксиклор,
метоксифенозиди, метолкарб, метоксидіазони,
мевінфос, мілбемектин, мілбеміцин, МКІ-245,
MON-45700, монокротофос, моксидектин, МТІ-800,
налед, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-
196, ніклозаміди, нікотини, нитенпірам, нитіазини,
NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768,
новалурон, новіфлумурон,

ОК-5101, ОК-5201, ОК-9601, ОК-9602, ОК-
9701, ОК-9802, ометоати, оксаміл, оксидеметон-
метил,

Raecilomyces fumosoroseus, паратіон-метил,
паратіон(-етил), перметрин (цис-, транс-), нафта,
РН-6045, фенотрин (1R-транс-ізомер), фентоати,
форати, фозалони, фосмет, фосфамідон,
фосфокарб, фоксим, піпероніл бутоксиди,
піримікарб, піриміфос-метил, піриміфос-етил,
пралетрин, профенофос, промеккарб, пропафос,
пропаргіти, пропетафос, пропоксур, протіофос,
протоати, протрифенбути, піметрозини,
піраклофос, піресметрин, піретрум, піридабен,
піридаліл, піридафентіон, піридатіон, піримідифен,
пірипроксифен,

хіналфос, ресметрин, RH-5849, рибавірин, RU-
12457, RU-15525,

S-421, S-1833, салітіон, себуфос, SI-0009,
силафлуофен, спіносад, спіродиклофен,
спіромезифен, сульфлурамід, сульфотеп,
сульпрофос, SZI-121,

тау-флувалінати, тебуфенозиди,
тебуфенпірад, тебупіримфос, тефлубензурон,
тефлутрин, темефос, темівінфос, тербам,
тербуфос, тетраклорвінфос, тетрадифон,
тетраметрин, тетраметри (1R-ізомер), тетрасул,
тега-циперметрин, тіаклопрід, тіаметоксам,
тіапроніл, тіатрифос, тіоциклам гідрооксалати,
тіодикарб, тіофанокс, тіометон, тіосультап-натрій,
турингієнсин, толфенпірад, тралоцитрин,
тралометрин, трансфлутрин, триаратени,
триазамати, триазофос, триазурон,
трихлорфенідини, трихлорфон, трифлумурон,
триметакарб,

вамідотіон, ваніліпроли, вербутин, Verticillium
lesanii,

WL-108477, WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-
5302, ХМС, ксилілкарб, ZA-3274, зета-
циперметрин, золапрофос, ZXI-8901,

сполука 3-метилфенілпропілкарбамат
(тсумацид Z),

сполука 3-(5-хлор-3-піридиніл)-8-(2,2,2-
трифторетил)-8-азабіцикло[3.2.1]октан-3-
карбонітрил (CAS-реєстр №185982-80-3) та
відповідні 3-ендо-ізомери (CAS-реєстр №185984-
60-5) [див. WO 96/37494, WO 98/25923],

а також препарати, які містять інсектицидно
активні рослинні екстракти, нематоди, гриби або
віруси.

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

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

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

самої активної речовини в фунт. Можливо також обробляти насіння рослин перед посівом.

При застосуванні активних речовин згідно з винаходом як фунгіцидів витратні кількості в залежності від виду нанесення можуть варіюватися в широкому діапазоні. При обробці частин рослин витратна кількість активної речовини загалом становить від 0,1 до 10 000г/га, переважно від 10 до 1000г/га. При обробці насіння витратна кількість активної речовини загалом становить від 0,001 до 50г на кілограм насіння, переважно від 0,01 до 10г на кілограм насіння. При обробці ґрунту витратна кількість активної речовини загалом становить від 0,1 до 10000г/га, переважно від 1 до 5000г/га.

Засоби, які застосовують для захисту технічного матеріалу, містять активну речовину загалом у кількості від 1 до 95%, переважно від 10 до 75%.

Концентрації активних речовин згідно з винаходом залежать від виду та походження мікроорганізмів, з якими необхідно боротися, а також від складу матеріалу, що підлягає захисту. Оптимальні витратні кількості можна визначити при проведенні ряду досліджень. Загалом концентрації активних речовин становлять від 0,001 до 5ваг.%, переважно від 0,05 до 1,0ваг.%, залежно від виду матеріалу, що підлягає захисту.

Ефективність та спектр дії застосовуваних у захисті матеріалу активних речовин згідно з винаходом або одержаних із них засобів, концентратів або композицій можуть бути підвищені шляхом додавання, в разі необхідності, інших антимікробних сполук, фунгіцидів, бактерицидів, гербіцидів, інсектицидів або інших активних речовин для збільшення спектру дії або досягнення особливих ефектів, наприклад, таких, як додатковий захист від комах. Ці суміші можуть мати більш широкий спектр дії, ніж сполуки згідно з винаходом.

Крім того активні речовини згідно з винаходом при їх застосуванні як інсектицидів у своїх наявних у продажу композиціях, а також у одержаних із цих композицій готових до застосування формах можуть бути застосовані у суміші із синергістами. Синергістами є сполуки, які посилюють дію активних речовин, при цьому сам застосовуваний синергіст не проявляє ніякої активності.

Крім того активні речовини згідно з винаходом при їх застосуванні як синергістів у своїх наявних у продажу композиціях, а також у одержаних із цих композицій готових до застосування формах можуть бути застосовані у суміші із інгібіторами, які уповільнюють розпад активної речовини після її застосування в оточенні рослини, на поверхні її частин або у тканинах рослин.

Вміст активної речовини у готових до застосування формах, одержаних із наявних у продажу композицій, може коливатися у широкому діапазоні. Концентрація активної речовини у готових до застосування формах може становити від 0,0000001 до 95ваг.% активної речовини, переважно від 0,0001 до 1ваг.%.

Застосування відбувається відповідно підібраним для кожної форми способом. При застосуванні проти побутових шкідників та

шкідників запасів активні речовини відрізняються сильною залишковою дією на деревині та глині, а також високою стабільністю по відношенню до лугів на вапнованих основах.

Як вже було зазначено вище, згідно з винаходом можуть бути оброблені всі рослини та їх частини. У переважній формі виконання винаходу обробляють дикоростучі рослини або види та сорти рослин, а також їх частини, одержані звичайними методами біологічного розведення, наприклад, схрещуванням або злиттям протопластів. В іншій переважній формі виконання обробляють трансгенні рослини та сорти рослин, одержані генно-технологічними методами, в разі необхідності, у комбінації зі звичайними методами (генетично модифіковані організми), та їх частини. Поняття «частини» або «частини рослин» або «органи рослин» було пояснено вище.

Найбільш переважно згідно з винаходом обробляють рослини комерційно доступних сортів або тих сортів, що знаходяться у постійному використанні. Під сортами рослин розуміють рослини з новими властивостями (ознаками), що одержують звичайним розведенням, мутагенезом або рекомбінантними методиками ДНК. Це можуть бути сорти, види, біотики та генотипи.

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

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

для рослин грибки, бактерії та/або віруси, а також підвищена толерантність рослин до певних гербіцидних активних речовин. Як приклади трансгенних рослин слід згадати важливі культурні рослини, такі як зернові (пшениця, рис), кукурудза, соя, картопля, бавовна, тютюн, рапс, а також фруктові рослини (із плодами яблук, груш, плодами цитрусових та виноград), причому особливу перевагу надають кукурудзі, сої, картоплі, бавовні, тютюну та рапсу. До особливо переважних властивостей належать підвищення стійкості рослин до комах завдяки токсинам, що утворюються в рослинах, особливо таким, які створюються за допомогою генетичного матеріалу з *Bacillus Thuringiensis* (наприклад, за допомогою генів CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb та CryIF, а також їх комбінацій) у рослинах (надалі "Бт. рослини"). До особливо переважних властивостей належать також підвищення стійкості рослин по відношенню до грибків, бактерій та вірусів завдяки набутій системній стійкості (SAR), системіну, фітоалексину, еліциторам, а також генам резистентності та відповідно експримованим протеїнам та токсинам. Крім того до особливо переважних властивостей належать також підвищення толерантності рослин по відношенню до певних гербіцидно активних речовин, наприклад, імідазолінів, сульфонілкарбамідів, гліфозатів або фосфінотрицину (наприклад, "ПАТ"-ген). Гени, що забезпечують бажані властивості, можуть зустрічатися в трансгенних рослинах в комбінаціях між собою. Прикладами "Бт. рослин" є сорти кукурудзи, бавовни, сої та картоплі, наявні у продажу під торговельними марками YIELD GARD® (наприклад, кукурудза, бавовна, соя), KnockOut® (наприклад, кукурудза), StarLink® (наприклад, кукурудза), Bollgard® (бавовна), Nucotn® (бавовна) та NewLeaf® (картопля). Прикладами толерантних до гербіцидів рослин є сорти кукурудзи, сорти бавовни та сорти сої, наявні у продажу під торговельними марками Roundup Ready® (толерантність по відношенню до гліфозату, наприклад, кукурудза, бавовна, соя), Liberty Link® (толерантність по відношенню до фосфінотрицину, наприклад, рапс), IMI® (толерантність по відношенню до імідазолінів) та STS® (толерантність по відношенню до сульфонілкарбамідів, кукурудза). Стійкими до гербіцидів (звичайно вирощені в умовах толерантності по відношенню до гербіцидів) рослинами є наявні у продажу під назвою Clearfield® сорти рослин (наприклад, кукурудза). Зрозуміло, що ці висловлення справедливі і для сортів рослин, що будуть одержані в майбутньому або які в майбутньому потраплять на ринок, з цими або в майбутньому створеними генетичними властивостями.

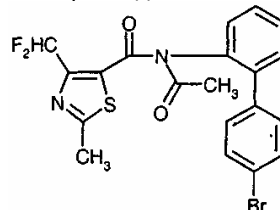
Особливо переважно згідно з винаходом наведені рослини можуть бути оброблені сполуками загальної формули (I) або сумішами активних речовин згідно з винаходом. Переважні області значень, наведені вище при описі активних речовин або їх сумішей, також використовуються для обробки цих рослин. Абсолютну перевагу

надають обробці рослин сполуками або сумішами, спеціально описаними в даному тексті.

Одержання та застосування активних речовин згідно з винаходом демонструють наведені нижче приклади.

Приклади одержання

Приклад 1



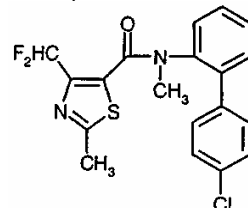
N-(4'-бром-1,1'-біфеніл-2-іл)-4-(дифторметил)-2-метил-1,3-тіазол-5-карбоксамід (0,3г, 0,7ммоль) поміщають у тетрагідрофуран (20мл) та додають гідрід натрію (60%-ний, 34мг, 0,85ммоль). Через 15 хвилин при кімнатній температурі додають ацетилхлорид (50мкл, 0,7ммоль) та протягом 5 годин перемішують при 50°C.

Для переробки суміш промивають насиченим розчином гідрокарбонату натрію, екстрагують етиловим естером оцтової кислоти, сушать над сульфатом натрію та концентрують у вакуумі.

Одержують 0,31г (95% від теор.) N-ацетил-N-(4'-бром-1,1'-біфеніл-2-іл)-4-(дифторметил)-2-метил-1,3-тіазол-5-карбоксаміду

logP (pH2,3)=3,61.

Приклад 2



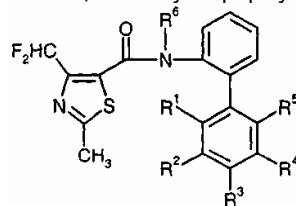
N-(4'-хлор-1,1'-біфеніл-2-іл)-4-(дифторметил)-2-метил-1,3-тіазол-5-карбоксамід (0,3г, 0,8ммоль) поміщають у тетрагідрофуран (20мл) та додають гідрід натрію (60%-ний, 23мг, 1,0ммоль). Через 15 хвилин при кімнатній температурі додають метилйодид (100мкл, 1,6ммоль) та протягом 16 годин кип'ятять із зворотнім холодильником.

Для переробки суміш промивають гідрокарбонатом натрію, екстрагують етиловим естером оцтової кислоти, органічну фазу сушать над сульфатом натрію, фільтрують та концентрують.

Одержують 0,25г (80% від теор.) N-(4'-хлор-1,1'-біфеніл-2-іл)-4-дифторметил-N,2-диметил-1,3-тіазол-5-карбоксаміду.




logP (pH2,3)=3,34.

Аналогічно прикладам 1 та 2, а також відповідно до інформації, вказаної при загальному описі способу (A), одержують наведені нижче в таблиці 1 сполуки формули (I).

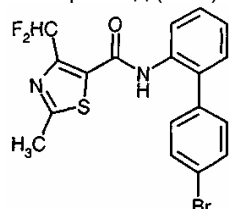


(I)

Таблиця 1

Приклад	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	logP
3	H	CH ₃	Cl	H	H		4,24
4	H	Cl	H	Cl	H		4,28
5	H	H	Cl	H	H		3,94
6	H	H	Br	H	H	-CH ₃	3,44
7	H	H	F	H	H	-CH ₃	2,99
8	H	H	F	H	H	-COCH ₃	3,16
9	H	H	Cl	H	H	-COCH ₂ OCH ₃	3,34

Одержання вихідних речовин Формули (II)
Приклад (11-1)

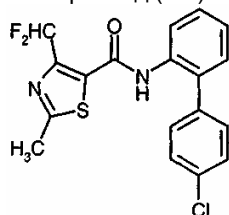


23,2г (0,09моль) 4'-бром-1,1'-біфеніл-2-аміну та 26,0мл (0,19моль) триетиламіну поміщають в 1,0л тетрагідрофурану та при температурі від -10 до -20°C повільно додають розчин 21,8г (0,10моль) 2-метил-4-(дифторметил)-1,3-тіазол-5-карбонілхлориду в 200мл тетрагідрофурану. Реакційний розчин протягом 2 годин перемішують при 0°C. Для переробки розчин концентрують та розділяють хроматографічним способом за допомогою суміші циклогексан/етиловий естер оцтової кислоти на силікагелі.

Одержують 27,8г (70% від теор.) N-(4'-бром-1,1'-біфеніл-2-іл)-2-метил-4-(дифторметил)-1,3-тіазол-5-карбоксаміду.

logP (pH2,3)=3,34, точка плавлення 151°C.

Приклад (II-2)



65,1г (0,32моль) 4'-бром-1,1'-біфеніл-2-аміну та 74,0мл (0,53моль) триетиламіну поміщають в 2,01л тетрагідрофурану та при температурі від -10 до -20°C повільно додають розчин 56,3г (0,27моль) 2-метил-4-(дифторметил)-1,3-тіазол-5-карбонілхлориду в 500мл тетрагідрофурану. Реакційний розчин протягом 2 годин перемішують при 0°C. Для переробки розчин концентрують та розділяють хроматографічним способом за допомогою суміші циклогексан/етиловий естер оцтової кислоти на силікагелі.

Одержують 43,88г (44,5% від теор.) N-(4'-бром-1,1'-біфеніл-2-іл)-2-метил-4-(дифторметил)-1,3-тіазол-5-карбоксаміду.

logP (pH2,3)=3,26, точка плавлення 144°C.

Визначення вказаних у таблицях та прикладах одержання значень logP відбувається згідно з Directive 79/831 Annex V.A8 за допомогою HPLC (High Performance Liquid Chromatography - вискоєфективної рідинної хроматографії) на колоні інверсії фаз (C 18). Температура: 43°C.

Визначення відбувається в кислому середовищі при рівні pH2,3 за допомогою 0,1% водного розчину фосфорної кислоти та ацетонітрилу як елюенту; лінійний градієнт від 10% ацетонітрилу до 90% ацетонітрилу.

Калібрування відбувається за допомогою нерозгалужених алкан-2-онів (що містять 3-16 атомів вуглецю), logP-значення яких відомі (визначення logP-значень на основі часу утримування шляхом лінійної інтерполяції між двома розташованими один за одним алканонами).

λ-макс-значення визначають на основі УФ-спектрів від 200нм до 400нм максимальних сигналів хроматографа.

Приклади застосування

Приклад А

Дослідження *Sphaerotheca* (на огірках) / захисна дія

Розчинник: 24,5ваг. частин ацетону,

24,5ваг. частин диметилацетаміду,

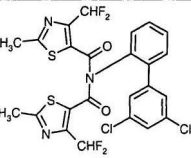
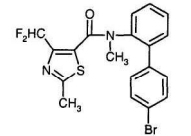
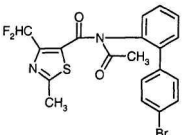
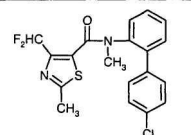
Емульгатор: 1,0ваг. частина алкіларилполігліколевого етеру.

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

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

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

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

Таблиця А: Дослідження Sphaerotheca (на огірках) / захисна дія			
Приклад	Активна речовина	Витратна кількість активної речовини в г/га	Ступінь дії в %
4		100	100
6		100	100
1		100	100
2		100	95

Приклад В

Дослідження Venturia (на яблуках) / захисна дія

Розчинник: 24,5ваг. частин ацетону,

24,5ваг. частин диметилацетаміду,

Емульгатор: 1,0ваг. частина алкіларилполігліколевого етеру.

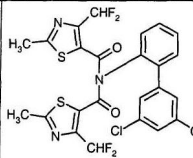
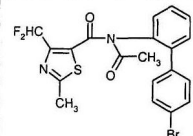
Для одержання необхідної композиції активних речовин 1 вагову частину активної речовини перемішують із вказаною кількістю розчинника та емульгатора, концентрат розріджують до необхідної концентрації водою.

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

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

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

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

Таблиця В: Дослідження Venturia (на яблуках) / захисна дія			
Приклад	Активна речовина	Витратна кількість активної речовини в г/га	Ступінь дії в %
4		100	99
1		100	100

Приклад С

Дослідження Botrytis (на бобах) / захисна дія

Розчинник: 24,5ваг. частин ацетону,

24,5ваг. частин диметилацетаміду,

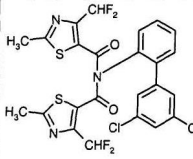
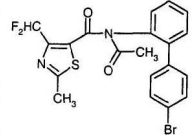
Емульгатор: 1,0ваг. частина алкіларилполігліколевого етеру.

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

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

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

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

Таблиця С: Дослідження Botrytis (на бобах) / захисна дія			
Приклад	Активна речовина	Витратна кількість активної речовини в г/га	Ступінь дії в %
4		500	94
1		500	98

Приклад Р

Дослідження *Alternaria* (на помідорах) / захисна дія

Розчинник: 49ваг. частин N,N-диметилформаміду

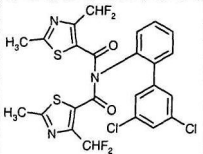
Емульгатор: 1ваг. частина алкіларилполігліколевого етеру.

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

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

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

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

Таблиця D: Дослідження <i>Alternaria</i> (на помідорах) / захисна дія			
Приклад	Активна речовина	Витратна кількість активної речовини в г/га	Ступінь дії в %
4		750	95