



УКРАЇНА

(19) UA (11) 56156 (13) C2

(51) 7 C07D413/12, 273/00,
413/14, A01N43/88МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) ПОХІДНІ ГАЛОГЕНОПІРИМІДИНІВ, ЗАСІБ ТА СПОСІБ БОРОТЬБИ ІЗ ШКІДНИКАМИ, ПРОМІЖНІ СПОЛУКИ

1

2

(21) 98084522
(22) 15 01 1997
(24) 15 05 2003
(86) PCT/EP97/00151, 15 01 1997
(31) 196 02 095 6
(32) 22 01 1996
(33) DE
(46) 15 05 2003, Бюл. № 5, 2003 р

(72) Хейнеманн Ульріх, DE, Гаср Херберт, DE, Гердес Петер, DE, Крюгер Бернд-Віланд, DE, Гаппенкамп Бернд, DE, Штельцер Уве, DE, Мархольд Альбрехт, DE, Тіманн Ральф, DE, Дутцманн Штефан, DE, Хенсслер Герд, DE, Штенцель Клаус, DE

(73) БАЙЕР АКЦІОНГЕЗЕЛЬШАФТ, DE

(56) RU, 2019543, C1, 1994

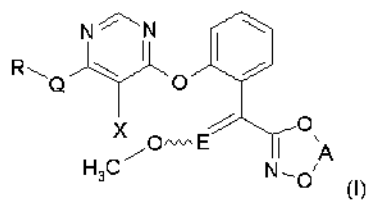
RU, 2043990, C1, 1995

EP, 471262, A1, 1992

DE, 44 08 005, A, 1995

EP, 468684, A1, 1995

(57) 1 Сполука формули (I)



в якій А означає при необхідності заміщений алкандііл,

R означає при необхідності заміщений циклоалкіл, арил або бензоконденсований гетероцикліл,

E означає -CH= або азот,

Q означає кисень, сірку, -CH₂-O-, простий зв'язок або при необхідності заміщений алкілом атом азоту, а

X означає галоген

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

A означає при необхідності заміщений галогеном алкандііл з 1-5 атомами вуглецю,

R означає при необхідності одно-двозаміщений галогеном, алкілом або гідроксигрупою циклоалкіл з 3-7 атомами вуглецю,

означає при необхідності заміщений алкілом з 1-4 атомами вуглецю бензодіоксаніл

або означає при необхідності одно-

чотиризаміщений однаковими або різними замісниками феніл або нафтил, причому можливі замісники вибрані переважно із наведеного нижче переліку

галоген, ціано, нітро, аміно, гідрокси, форміл, карбокси, карбаміл, тіокарбаміл,

лінійний або розгалужений алкіл, гідроксіалкіл, оксоалкіл, алкокси, алкоксилалкіл, алкілтіоалкіл,

діалкоксилалкіл, алкілтіо, алкілсульфініл або алкілсульфоніл з 1-8 атомами вуглецю,

лінійний або розгалужений алкеніл або алкенілокси з 2-6 атомами вуглецю,

лінійний або розгалужений галогеналкіл, галогеналкокси, галогеналкілтіо, галогеналкілсульфініл або галогеналкілсульфоніл з 1-6 атомами вуглецю та з 1-13 однаковими або різними атомами галогену,

лінійний або розгалужений галогеналкеніл або галогеналкенілокси з 2-6 атомами вуглецю та з 1-11 однаковими або різними атомами галогену,

лінійний або розгалужений алкіламіно, діалкіламіно, алкілкарбоніл, алкілкарбонілокси, алкокси-

карбоніл, алкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбоніл, арилалкіламінокарбоніл,

діалкіламінокарбонілокси, алкенілкарбоніл або алкінілкарбоніл з 1-6 атомами вуглецю у відповідних вуглеводневих ланцюгах,

циклоалкіл або циклоалкілокси з 3-6 атомами вуглецю,

алкілен з 3 або 4 атомами вуглецю, оксіалкілен з 2 або 3 атомами вуглецю або діоксіалкілен з 1 або 2 атомами вуглецю та з подвійними зв'язками, при необхідності одно-чотиризаміщений однаковими або різними замісниками

фтор, хлор, оксо, метил, трифторметил або етил,



або групу A_2 , де

A¹ означає водень, гідрокси або алкіл з 1-4 атомами вуглецю або циклоалкіл з 1-6 атомами вуглецю, а

A² означає гідрокси, аміно, метиламіно, феніл, бензил або означає при необхідності заміщений ціано, гідрокси, алкокси, алкілтіо, алкіламіно, діалкіламіно або фенілом алкіл або алкокси з 1-4

(13) C2

(11) 56156

(19) UA

атомами вуглецю, або означає алкенілокси або алкінілокси з 2-4 атомами вуглецю, а також при необхідності в циклічній частині одностризащений галогеном та/або лінійним або розгалуженим алкілом або алкокси з 1-4 атомами вуглецю феніл, фенокси, фенілтїю, бензоїл, бензоїлетеніл, цинамоїл, гетероциклїл, фенїлалкіл, фенїлалкілокси, фенїлалкілтїю або гетероциклїлалкіл з 1-3 атомами вуглецю у відповідних алкільних частинах,

E означає -CH= або азот,

Q означає кисень, сірку, простий зв'язок або означає при необхідності заміщений метилом, етилом або n- або i-пропілом атом азоту, а

X означає фтор, хлор, бром або йод

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

A означає при необхідності заміщений фтором або хлором метилен, етан-1,1-діл, етан-1,2-діл, пропан-1,1-діл, пропан-1,2-діл, пропан-1,3-діл, бутан-1,1-діл, бутан-1,2-діл, бутан-1,3-діл або бутан-2,2-діл,

R означає при необхідності одно-двозаміщений фтором, хлором, метилом, етилом або гідроксигрупою циклопентил або циклогексил, означає при необхідності заміщений метилом або етилом бензодіоксаніл,

або означає при необхідності одностризащений однаковими або різними замісниками феніл або нафтил, причому можливі замісники вибрані переважно із наведеного нижче переліку

фтор, хлор, бром, йод, ціано, нїтро, аміно, гідрокси, формїл, карбокси, карбамоїл, тіокарбамоїл, метил, етил, n- або i-пропіл, n-, i-, s- або t-бутил, 1-, 2-, 3-, неопентил, 1-, 2-, 3-, 4-(2-метилбутил), 1-, 2-, 3-гексил, 1-, 2-, 3-, 4-, 5-(2-метилпентил), 1-, 2-, 3-(3-метилпентил), 2-етилбутил, 1-, 3-, 4-(2,2-диметилбутил), 1-, 2-(2,3-диметилбутил), гідроксиметил, гідроксїетил, 3-оксобутил, метоксиметил, диметоксиметил, метокси, етокси, n- або i-пропокси, метїлтїю, етїлтїю, n- або i-пропілтїю, метилсульфїніл, етилсульфїніл, метилсульфонїл або етилсульфонїл, вініл, алїл, 2-метїлалїл, пропен-1-їл, кротонїл, пропаргїл, вінілокси, алїлокси, 2-метїлалїлокси, пропен-1-їлокси, кротонїлокси, пропарпїлокси,

трифторметил, трифторетил, дифторметокси, трифторметокси, дифторхлорметокси, трифторетокси, дифторметїлтїю, трифторметїлтїю, дифторхлорметїлтїю, трифторметїлсульфїніл або трифторметїлсульфонїл, метїламіно, етїламіно, n- або i-пропіламіно, диметїламіно, діетїламіно, ацетил, пропіонїл, метоксикарбонїл, етоксикарбонїл, метїламінокарбонїл, етїламінокарбонїл, диметїламінокарбонїл, діетїламінокарбонїл, диметїламінокарбонїлокси, діетїламінокарбонїлокси, бензіламінокарбонїл, акрілоїл, пропіолоїл, циклопентил, циклогексил, пропандїл, етїленокси, метїлендіокси, етїлендіокси з подвійними зв'язками при необхідності одностризащений однаковими або різними замісниками фтор, хлор, оксо, метил або трифторметил,

або групу A^1 A^2 N , причому

A^1 означає водень, метил або гідрокси, а

A^2 означає гідрокси, метокси, етокси, аміно, метїламіно, фенїл, бензіл або гідроксїетїл, а також при необхідності в циклічній частині одностризащений галогеном та/або лінійним або розгалуженим алкілом або алкокси з 1-4 атомами вуглецю феніл, фенокси, фенілтїю, бензоїл, бензоїлетенїл, цинамоїл, бензіл, фенїлетїл, фенїлпропіл, бензілокси, бензілтїю, 5,8-дїгдро-1,4,2-діоксазїн-3-їлметїл, тїазолїлметїл, бензоксазол-2-їл-метїл, 1,3-діоксан-2-їл, бензімїдазол-2-їл, діоксол-2-їл, оксадіазолїл,

E означає -CH= або азот,

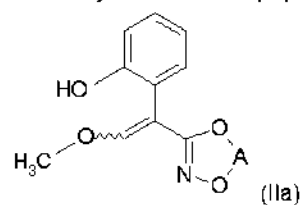
Q означає кисень, сірку, простий зв'язок або означає при необхідності заміщений метилом атом азоту, а

X означає фтор або хлор

4 Засіб для боротьби зі шкідниками, який відрізняється тим, що він містить щонайменше одну сполуку формули (I) згідно з п. 1

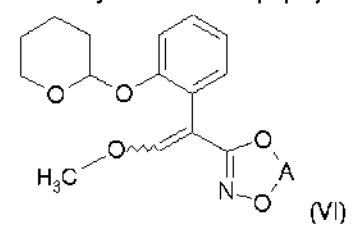
5 Спосіб боротьби зі шкідниками, який відрізняється тим, що сполуками формули (I) згідно з п. 1 діють на шкідників або середовище їх проживання

6 Сполука загальної формули (IIa)



в якій A має наведене в п. 1 значення

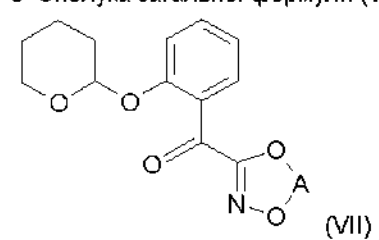
7 Сполука загальної формули (VI)



в якій

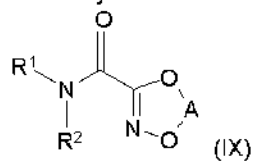
A має наведене в п. 1 значення

8 Сполука загальної формули (VII)



в якій A має наведене в п. 1 значення

9 Сполука загальної формули (IX)

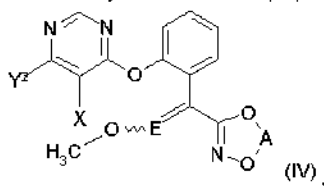


в якій A має наведене в п. 1 значення, а

R^1 і R^2 однакові або різні і означають алкіл або разом із атомом азоту, з яким вони зв'язані, озна-

чають (3-6)-членний насичений гетероциклічний цикл

10 Сполука загальної формули (IV)

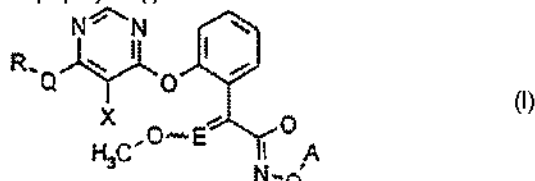


Винахід стосується нових галогенопіримідинів, способу їх одержання та їх застосування в якості засобів боротьби зі шкідниками

Певні піримідини зі схожими замісниками уже відомі (міжнародна публікація WO-A 9504728)

Однак, ефективність цих відомих сполук, особливо при малих застосовуваних кількостях та концентраціях, не у всіх галузях застосування повністю задовільна

Були винайдені нові галогенопіримідини загальної формули (I)



в якій А означає при необхідності заміщений алканділ,

Р означає при необхідності заміщений циклоалкіл, арил або бензоконденсований гетероцикліл,

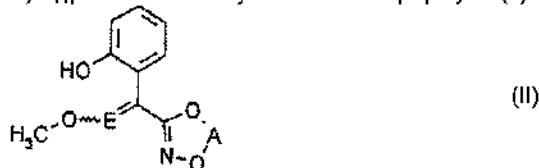
Е означає -CH= або азот,

Q означає кисень, сірку, -CH₂-O-, простий зв'язок або при необхідності заміщений алкілом атом азоту, а

Х означає галоген

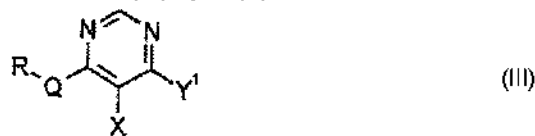
Крім того, було винайдено спосіб одержання нових галогенопіримідинів загальної формули (I), який полягає в тому, що

а) гідроксильні сполуки загальної формули (II)



в якій

А і Е мають наведені вище значення, перетворюють заміщеним галогенопіримідином загальної формули (III),



в якій

Р, Q і Х мають наведені вище значення, а

Y¹ означає галоген,

при необхідності в присутності розріджувача,

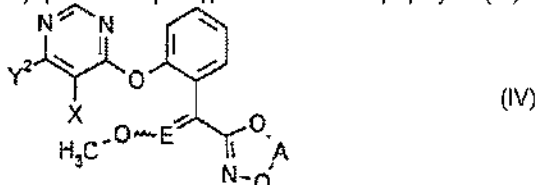
в якій

А, Е і Х мають наведені в п. 1 значення, а

Y² означає галоген

при необхідності в присутності кислотного акцептора і при необхідності в присутності каталізатора, або

б) феноксіпіримідини загальної формули (IV)



в якій

А, Е і Х мають наведені вище значення, а

Y² означає галоген, перетворюють циклічною сполукою загальної формули (V),

R-Q-H (V)

в якій R і Q мають наведені вище значення,

при необхідності в присутності розріджувача, при необхідності в присутності кислотного акцептора і при необхідності в присутності каталізатора

І, нарешті, було встановлено, що нові галогенопіримідини загальної формули (I) мають дуже сильну фунгіцидну дію

Сполуки згідно з винаходом можуть перебувати при необхідності у вигляді сумішей різних можливих ізомерних форм, зокрема, стереоізомерів, наприклад, Е- і Z-ізомерів. Заявляються як Е-, так і Z-ізомери, а також будь-які суміші цих ізомерів

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

А означає при необхідності заміщений галогеном алканділ з 1-5 атомами вуглецю,

Р означає при необхідності від одно- до дво-заміщений галогеном, алкілом, або гідрокси циклоалкіл з 3 - 7 атомами вуглецю,

означає при необхідності заміщений алкілом з 1 - 4 атомами вуглецю бензодіоксаніл,

або означає при необхідності від одно- до чотиризаміщений однаковими або різними замісниками феніл або нафтил, причому можливі замісники вибрані переважно із наведеного нижче переліку

галоген, ціано, нитро, аміно, гідрокси, форміл, карбокси, карбамоіл, тіо-карбамоіл,

лінійний або розгалужений алкіл, гідроксиалкіл, оксоалкіл, алкокси, алкоксиалкіл, алкілтіоалкіл, діалкоксиалкіл, алкілтію, алкілсульфініл або алкілсульфоніл з 1 - 8 атомами вуглецю,

лінійний або розгалужений алкеніл або алкенілокси з 2 - 6 атомами вуглецю,

лінійний або розгалужений галогеноалкіл, га-

логеналкокси, галоген-алкілтіо, галогеналкілсульфініл або галогеналкілсульфоніл з 1 - 6 атомами вуглецю та з 1 - 13 однаковими або різними атомами галогену,

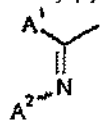
лінійний або розгалужений галогеналкеніл або галогеналкенілокси з 2 - 6 атомами вуглецю та з 1 - 11 однаковими або різними атомами галогену,

лінійний або розгалужений алкіламіно, діалкіламіно, алкіл-карбоніл, алкілкарбонілокси, алкоксикарбоніл, алкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбоніл, арилалкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбонілокси, алкеніл-карбоніл або алкінілкарбоніл з 1 - 6 атомами вуглецю у відповідних вуглеводневих ланцюгах,

циклоалкіл або циклоалкілокси з 3 - 6 атомами вуглецю,

алкілен з 3 або 4 атомами вуглецю оксиалкілен з 2 або 3 атомами вуглецю або діоксиалкілен з 1 або 2 атомами вуглецю та з подвійними зв'язками, при необхідності від одно- до чотиризаміщений однаковими або різними замісниками фтор, хлор, оксо, метил, трифторметил або етил,

або угруповання



де

A¹ означає водень, гідрокси або алкіл з 1 - 4 атомами вуглецю або циклоалкіл з 1 - 6 атомами вуглецю, а

A² означає гідрокси, аміно, метиламіно, феніл, бензил або означає при необхідності заміщений ціано, гідрокси, алкокси, алкілтіо, алкіламіно, діалкіламіно або фенілом алкіл або алкокси з 1 - 4 атомами вуглецю, або означає алкенілокси або алкінілокси з 2 - 4 атомами вуглецю,

а також при необхідності в циклічній частині від одно- до тризаміщений галогеном та/або лінійним або розгалуженим алкілом або алкокси з 1 - 4 атомами вуглецю феніл, фенокси, фенілтіо, бензоіл, бензоіл-етеніл, циннамоіл, гетероцикліл, фенілалкіл, фенілалкілокси, фенілалкілтіо або гетероцикліалкіл з 1 - 3 атомами вуглецю у відповідних алкільних частинах,

E означає -CH= або азот,

Q означає кисень, сірку, простий зв'язок або означає при необхідності заміщений метилом, етилом або n- або i-пропілом атом азоту, а

X означає фтор, хлор, бром або йод

У визначеннях насичені або ненасичені вуглеводневі ланцюги, такі як алкіл, алканділ, алкеніл або алкініл, також у зв'язку з гетероатомами, наприклад, в алкокси, алкілтіо або алкіламіно є лінійними або розгалуженими

Винахід стосується, зокрема, сполуки формули (I), в якій A означає при необхідності заміщений фтором або хлором метилен, етан-1,1-діл, етан-1,2-діл, пропан-1,1-діл, пропан-1,2-діл, пропан-1,3-діл, бутан-1,1-діл, бутан-1,2-діл, бутан-1,3-діл або бутан-2,2-діл,

R означає при необхідності від одно- до дво-заміщений фтором, хлором, метилом, етилом або гідрокси-групою циклопентил або циклогексил,

означає при необхідності метилом або етилом

заміщений бензодіоксаніл,

або означає при необхідності від одно- до чотиризаміщений однаковими або різними замісниками феніл або нафтил, причому можливі замісники вибрані переважно із наведеного нижче переліку

фтор, хлор, бром, йод, ціано, нітро, аміно, гідрокси, форміл, карбокси, карбамоіл, tioкарбамоіл,

метил, етил, n- або i-пропіл, n-, i-, s- або t-бутил, 1-, 2-, 3-, нео-пентил, 1-, 2-, 3-, 4-(2-метилбутил), 1-, 2-, 3-гексил, 1-, 2-, 3-, 4-, 5-(2-метилпентил), 1-, 2-, 3-(3-метилпентил), 2-етилбутил, 1-, 3-, 4-(2,2-диметилбутил), 1- 2-(2,3-диметилбутил), гідроксиметил, гідроксиетил, 3-оксобутил, метоксиметил, диметоксиметил,

метокси, етокси, n- або i-пропокси,

метилтіо, етилтіо, n- або i-пропілтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл,

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

трифторметил, трифторетил,

дифторметокси, трифторметокси, дифторхлорметокси, трифторетокси, дифторметилтіо, трифторметилтіо, дифторхлорметилтіо, трифторметил-сульфініл або трифторметилсульфоніл,

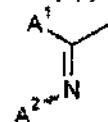
метиламіно, етиламіно, n- або i-пропіламіно, диметиламіно, діетил-аміно,

ацетил, пропіоніл, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, метиламінокарбоніл, етиламінокарбоніл, диметиламінокарбоніл, діетиламінокарбоніл, диметиламінокарбонілокси, діетиламінокарбонілокси, бензиламінокарбоніл, акрилоіл, пропіолоіл,

циклопентил, циклогексил,

пропанділ, етиленокси, метилендіокси, етилендіокси з подвійними зв'язками, при необхідності від одно- до чотиризаміщений однаковими або різними замісниками фтор, хлор, оксо, метил або трифторметил,

або угруповання



причому

A¹ означає водень, метил або гідрокси, а

A² означає гідрокси, метокси, етокси, аміно, метиламіно, феніл, бензил або гідроксиетил, а також

при необхідності в циклічній частині від одно- до тризаміщений галогеном та/або лінійним або розгалуженим алкілом або алкокси з 1 - 4 атомами вуглецю феніл, фенокси, фенілтіо, бензоіл, бензоіл-етеніл, циннамоіл, бензил, фенілетил, фенілпропіл, бензілокси, бензилтіо, 5,6-дигідро-1,4,2-діоксазин-3-ілметил, триазолілметил, бензоксазол-2-іл-метил, 1,3-діоксан-2-іл, бензімідазол-2-іл, діоксол-2-іл, оксадіазоліл,

E означає -CH= або азот,

Q означає кисень, сірку, простий зв'язок або означає при необхідності заміщений метилом атом азоту, а X означає фтор або хлор

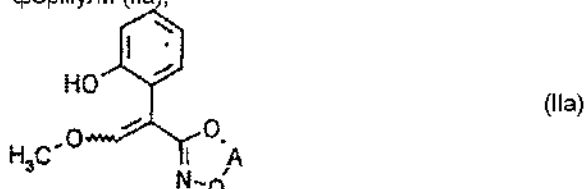
Наведені вище загальні або вказані для переведених діапазонів визначення записків дійсні як

для кінцевих продуктів формули (I), так відповідно і для вихідних або проміжних продуктів, необхідних для їх одержання

Визначення залишків, наведені в комбінаціях або в переважних комбінаціях залишків окремо для цих залишків, можуть бути - незалежно від даної наведеної комбінації - замінені будь-яким визначенням залишків з іншого переважного діапазону

Необхідні в якості вихідних матеріалів для здійснення способу а) згідно з винаходом гідроксильні сполуки визначені загальною формулою (II) В цій формулі (II) А і Е мають переважно або зокрема ті ж значення, що були наведені у зв'язку з описом сполук формули (I) як переважні або особливо переважні для А і Е

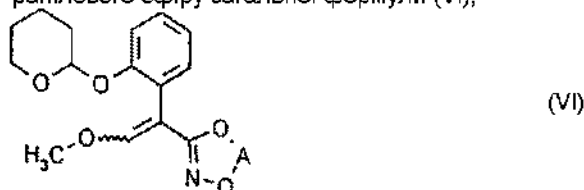
Вихідні сполуки формули (II) частково відомі та/або можуть бути одержані відомими способами (див WO-A 9504728) Новими, а також предметом даної заявки, є метоксивінілові сполуки загальної формули (IIa),



в якій

А має наведене вище значення

Метоксивінілові сполуки формули (IIa) одержують (спосіб а-1) шляхом обробки тетрагідропіранілового ефіру загальної формули (VI),



в якій

А має наведене вище значення,

при необхідності в присутності розріджувача, переважно простого ефіру, такого як діетиловий ефір, дізопропіловий ефір, метил-1-бутиловий ефір, метил-1-аміловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксиетан, 1,2-діетоксиетан або анізол, сульфоксиду, такого як диметил сульфоксид, сульфону, такого як сульфолан, спирту, такого як метанол, етанол, n- або i-пропанол, n-, i-, втор- або трет-бутанол, етандіол, пропан-1,2-діол, етоксидетанол, метоксидетанол, монометилловий ефір діетиленгліколю, моноетиловий ефір діетиленгліколю, їх сумішей з водою або чистої води

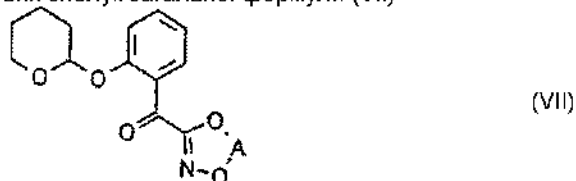
кислотою, переважно неорганічною або органічною протонною кислотою або кислотою Льюїса, такою як, наприклад, хлористий водень, сірчана кислота, фосфорна кислота, амеізенінова кислота, оцтова кислота, трифтороцтова кислота, метансульфонова кислота, трифторметансульфонова кислота, толуолсульфонова кислота, бортрифторид (також у вигляді етерату), бортрибромід, трихлорид алюмінію, хлорид цинку, хлорид заліза (III), антимонпентахлорид, або полімерною кислотою як, наприклад, кислим іонообмінником, кислим гінозетом або кислим силікагелем,

при температурах від -20°C до 120°C, переважно при температурах від -10°C до 80°C

Необхідні для здійснення винайденого способу а-1) в якості вихідних речовин тетрагідропіранілові ефіри визначені загальною формулою (VI) В цій формулі (VI) А має переважно або зокрема таке ж значення, яке при опису винайденої сполуки формули (I) було наведене як переважне або особливо переважне для А

Вихідні речовини формули (VI) є новими і також є предметом даної заявки

Тетрагідропіраніловий ефір формули (VI) одержують шляхом (спосіб а-2) перетворення кетонних сполук загальної формули (VII)



в якій А має наведене вище значення,

хлоридом, бромідом або йодидом метоксиметил-трифеніл-фосфонію, при необхідності в присутності розріджувача, переважно інертного, апротичного розчинника, наприклад, простого ефіру, такого як діетиловий ефір, дізопропіловий ефір, метил-1-бутиловий ефір, метил-1-аміловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксиетан, 1,2-діетоксиетан або анізол, амід, такого як N,N-диметил-формамід, N,N-диметилацетамід, N-метилформанлід, N-метилпіролідон або триамід гексаметилфосфорної кислоти, сульфоксиду, такого як диметилсульфоксид, або сульфону, такого як сульфолан, і

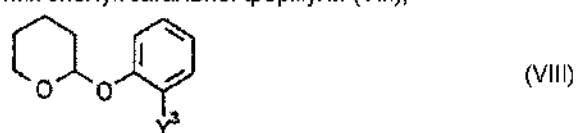
при необхідності в присутності основи, переважно гідриду, гідроксиду, амід, або алкоголяту лужно-земельного або лужного металу, такої як, наприклад, гідрид натрію, амід натрію, метилат натрію, етилат натрію, трет-бутилат калію, гідроксид натрію або гідроксид калію,

при температурах від 0°C до 100°C, переважно від 20°C до 80°C

Необхідні для здійснення винайденого способу а-2) в якості вихідних речовин кетонні сполуки визначені загальною формулою (VII) В цій формулі (VII) А має переважно або зокрема таке ж значення, яке при опису винайденої сполуки формули (I) було наведене як переважне або особливо переважне для А

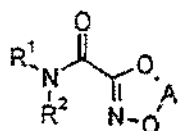
Вихідні речовини формули (VII) є новими і також є предметом даної заявки

Кетонні сполуки формули (VII) одержують шляхом (спосіб а-3) перетворення галогенфенільних сполук загальної формули (VIII),



в якій

Y³ означає галоген, амід, формули (IX),



(IX)

в якій

А має наведене вище значення, а

R^1 і R^2 однакові або різні і означають алкіл, або разом із атом азоту, з яким вони зв'язані, означають (3 - 8)-членний, насичений, гетероциклічний цикл,

при необхідності в присутності розріджувача, переважно аліфатичного, аlicиклічного або ароматичного вуглеводню, такого як, наприклад, петролейний ефір, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол або декалін, або простого ефіру, такого як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, метил-1-бутиловий ефір, метил-1-аміловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксиетан, 1,2-діетоксиетан або анізол і

при необхідності в присутності основи, переважно пдриди або амідів лужно-земельного або лужного металу, такої як, наприклад, пдрид натрію або амід натрію, або сполуки вуглеводу з лужно-земельним чи лужним металом, такої як бутиллітій,

при температурах від -80 до 20°C, переважно від -60 до -20°C

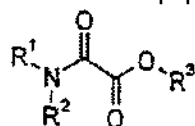
Необхідні для здійснення винайденого способу а-3) в якості вихідних речовин галогенофенільні сполуки визначені загальною формулою (VIII) В цій формулі (VIII) Y^3 означає галоген, переважно бром

Вихідні речовини формули (VIII) відомі та/або можуть бути одержані відомими способами (див., наприклад, Synthesis 1987, 951)

Необхідні для здійснення винайденого способу а-3) в якості вихідних речовин амідів визначені загальною формулою (IX) В цій формулі (IX) А має переважно або зокрема таке ж значення, яке при опису винайдені сполуки формули (I) було наведене як переважне або особливо переважне для А R^1 і R^2 однакові або різні і означають алкіл, переважно метил, етил, n- або i-пропіл або n-, i-, s- або t-бутил, або разом із атом азоту, з яким вони зв'язані, означають (3 - 8)-членний, насичений, гетероциклічний цикл, переважно азетипіліл, піролідиніл, морфолініл, піперидиніл, гексагідроазепініл

Вихідні речовини формули (IX) є новими і також є предметом даної заявki

Аміди формули (IX) одержують шляхом (спосіб а-4) перетворення ефірних амідів оксалоової кислоти загальною формули (X),



(X)

в якій R^1 і R^2 мають наведені вище значення, а R^3 означає алкіл,

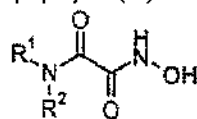
спочатку за допомогою гідроксиламіну або його кислотнo-адитивної солі, при необхідності в присутності розріджувача, переважно спирту, такого як метанол, етанол, n- або i-пропанол, n-, i-,

втор- або трет-бутанол, етандіол, пропан-1,2-діол, етоксietанол, метоксietанол, діетиленгліколь-монометилловий ефір, діетиленгліколь-моноетилловий ефір,

та при необхідності в присутності основи, переважно гідроксиду, алкоголяту, ацетату, карбонату або гідрокарбонату лужноземельного металу, такого як, наприклад, амід натрію, метилат натрію, етилат натрію, трет-бутилат калію, гідроксид натрію, гідроксид калію, ацетат натрію, ацетат калію, ацетат кальцію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат калію або гідрокарбонат натрію,

при температурах від -20 до 50°C, переважно від 0 до 40°C,

і одержану таким чином гідроксамову кислоту формули (XI)



(XI)

без доводки перетворюють похідною алкіпену загальною формули (XII),

$\text{Y}^4\text{-A-Y}^5$ (XII),

в якій А має наведене вище значення, а

Y^4 і Y^5 однакові або різні і означають галоген, алкілсульфоніл або арилсульфоніл,

при необхідності в присутності розріджувача, переважно спирту, та при необхідності в присутності основи, переважно гідроксиду, алкоголяту, ацетату, карбонату або гідрокарбонату лужноземельного металу, такої як, наприклад, амід натрію, метилат натрію, етилат натрію, трет-бутилат калію, гідроксид натрію, гідроксид калію, ацетат натрію, ацетат калію, ацетат кальцію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат калію або гідрокарбонат натрію

Ефірні амідів оксалоової кислоти, необхідні в якості вихідних речовин для проведення першої стадії винайденого способу а-4), визначені загальною формулою (X) В цій формулі (X) R^1 і R^2 мають переважно або зокрема такі ж значення, які при опису винайдені сполуки формули (IX) були вказані як переважні або особливо переважні для R^1 і R^2 R^3 означає алкіл, переважно метил або етил

Вихідні речовини формули (X) відомі та/або можуть бути одержані відомими способами (див., наприклад, EP-A469889)

Необхідний окрім того для проведення першої стадії винайденого способу а-4) гідроксиламін або його солі є звичайними хімікатами для проведення синтезу

Необхідні для проведення другої стадії винайденого способу а-4) в якості вихідних речовин похідні алкіпену визначені загальною формулою (XII) В цій формулі (XII) А має переважно або зокрема таке ж значення, яке при опису винайдені сполуки формули (I) було наведене як переважне або особливо переважне для А Y^4 і Y^5 однакові або різні і означають галоген, переважно хлор або бром, алкілсульфоніл, переважно метансульфоніл, або арилсульфоніл, переважно толуолсульфоніл

Необхідні окрім того для здійснення винайденого способу а) в якості вихідних речовин галогенопіримідини визначені загальною формулою (III)

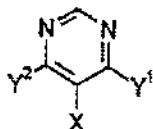
В цій формулі (III) R, Q і X мають переважно або зокрема такі ж значення, які при опису винайденої сполуки формули (I) були вказані як переважні або особливо переважні для R, Q і X. Y¹ означає галоген, переважно фтор або хлор.

Вихідні речовини формули (III) відомі та/або можуть бути одержані відомими способами (див., наприклад, DE-A 4340181, Chem. Ber., 90 <1957> 942, 951).

Необхідні для здійснення винайденого способу b) в якості вихідних речовин феноксіпіримідини визначені загальною формулою (IV). В цій формулі (IV) A, E і X мають переважно або зокрема такі ж значення, які при опису винайденої сполуки формули (I) були вказані як переважні або особливо переважні для A, E і X. Y² означає галоген, переважно фтор або хлор.

Вихідні речовини формули (IV) є новими і також є предметом даної заявки.

Феноксіпіримідини загальної формули (IV) одержують (спосіб b-1) шляхом перетворення гідроксильних сполук загальної формули (II) тригалогенпіримідином загальної формули (XIII).



(XIII)

в якій
X, Y¹ і Y² однакові або різні і означають галоген,

при необхідності в присутності розріджувача, при необхідності в присутності кислотного акцептора і при необхідності в присутності каталізатора.

Необхідні для здійснення винайденого способу b-1) в якості вихідних речовин гідроксильні сполуки формули (II) уже були описані при описі винайденого способу a).

Необхідні крім того для здійснення винайденого способу b-1) в якості вихідних речовин тригалогенпіримідини визначені загальною формулою (XIII). В цій формулі (XIII) X, Y¹ і Y² означають галоген, переважно фтор або хлор.

Тригалогенопіримідини відомі та/або можуть бути одержані відомими способами (див., наприклад, Chesterfield et al., J. Chem. Soc., 1955, 3478, 3480).

Необхідні крім того для здійснення винайденого способу b) в якості вихідних речовин циклічні сполуки визначені загальною формулою (V). В цій формулі (V) R і Q мають переважно або зокрема такі ж значення, які при описі винайдених сполук формули (I) були вказані як переважні або особливо переважні для R і Q.

Циклічні сполуки формули (V) є відомими хімікатами для синтезу речовин або можуть бути одержані простими способами.

В якості розріджувачів для здійснення винайдених способів a), b) та b-1) можуть бути використані всі інертні органічні розчинники. До них належать переважно прості ефіри, такі як діетиловий ефір, діізопропиловий ефір, метил-*t*-бутиловий ефір, метил-*t*-аміловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксиетан, 1,2-діетоксиетан або анізол, нітрили, такого як ацетонітрил, пропіонітрил, *n*- або *i*-бутиронітрил або бензонітрил, аміді,

такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метилформанлід, N-метилпіролідон або триамід гексаметилфосфорної кислоти, сульфоксиди, такі як диметилсульфоксид, або сульфони, такі як сульфолан.

Винайдені способи a), b) та b-1) здійснюються при необхідності в присутності підходящого кислотного акцептора. Як такі можуть бути використані всі звичайні неорганічні або органічні основи. До них належать гідриди, гідроксиди, алкоголяти, карбонати або гідрокарбонати лужноземельних або лужних металів, такі як, наприклад, гідрид натрію, амід натрію, трет-бутилат калію, гідроксид натрію, гідроксид калію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат калію або гідрокарбонат натрію.

Як каталізатори для винайдених способів a), b) і b-1) придатні всі солі міді (I), такі як хлорид міді (I), бромід міді (I) або йодид міді (I).

Температуру реакцій при здійсненні винайдених способів a), b) і b-1) можна змінювати в широких межах. В загальному випадку працюють при температурах від -20°C до 100°C, переважно при температурах від -10°C до 80°C.

Всі способи згідно з винаходом здійснюються при нормальному тиску. Можливе, однак, здійснення способів при зниженому або підвищеному тиску - в загальному випадку від 0,1 бардо 10 бар.

Проведення реакцій, доводку і виділення реакційних продуктів здійснюються звичайними методами (див. також приклади одержання).

Активні речовини згідно з винаходом мають сильну мікробіцидну дію і можуть бути на практиці використані для боротьби з небажаними мікроорганізмами. Активні речовини придатні для застосування в якості засобів захисту рослин, зокрема в ролі фунгіцидів.

Фунгіцидні засоби в галузі захисту рослин застосовують для боротьби з плазмодіоформіцетами, ооміцетами, хітридіоміцетами, цигоміцетами, аскоміцетами, базидіоміцетами, дейтеромицетами.

Бактерицидні засоби в галузі захисту рослин застосовують для боротьби з *Pseudomonadaceae*, *Rhizobiaceae*, *Enterobacteriaceae*, *Corynebacteriaceae* та *Streptomycetaceae*.

Для прикладу - але не обмежуючи обсягу винаходу - можуть бути названі деякі збудники грибкових та бактеріальних захворювань, які підпадають під перелічені родові назви.

Із виду *Xanthomonas*, наприклад, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*,

Із виду *Pseudomonas*, наприклад, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*,

Із виду *Erwinia*, наприклад, *Erwinia amylovora*,

Із виду *Pythium*, наприклад, *Pythium ultimum*,

Із виду *Phytophthora*, наприклад, *Phytophthora infestans*,

Із виду *Pseudoperonospora*, наприклад, *Pseudoperonospora humuli* або *Pseudoperonospora cubensis*,

Із виду *Plasmopara*, наприклад, *Plasmopara viticola*,

Із виду *Bremia*, наприклад, *Bremia lactucae*,

Із виду *Peronospora*, наприклад, *Peronospora pisi* або *P. brassicae*,

із виду *Erysiphe*, наприклад, *Erysiphe graminis*,
із виду *Sphaerotheca*, наприклад, *Sphaerotheca fuliginea*,

із виду *Podosphaera*, наприклад, *Podosphaera leucotricha*,

із виду *Venturia*, наприклад, *Venturia inaequalis*,

із виду *Pyrenophora*, наприклад, *Pyrenophora teres* або *P. graminea* (форма конідій *Drechslera*, синонім *Helminthosporium*),

із виду *Cochliobolus*, наприклад, *Cochliobolus sativus* (форма конідій *Drechslera*, синонім *Helminthosporium*),

із виду *Uromyces*, наприклад, *Uromyces appendiculatus*,

із виду *Puccinia*, наприклад, *Puccinia recondita*,

із виду *Sclerotinia*, наприклад, *Sclerotinia sclerotiorum*,

із виду *Tilletia*, наприклад, *Tilletia caries*,

із виду *Ustilago*, наприклад, *Ustilago nuda* або *Ustilago avenae*,

із виду *Pellicularia*, наприклад, *Pellicularia sakaii*,

із виду *Pyricularia*, наприклад, *Pyricularia oryzae*,

із виду *Fusarium*, наприклад, *Fusarium culmorum*,

із виду *Botrytis*, наприклад, *Botrytis cinerea*,

із виду *Septoria*, наприклад, *Septoria nodorum*,

із виду *Leptosphaeria*, наприклад, *Leptosphaeria nodorum*,

із виду *Cercospora*, наприклад, *Cercospora canescens*,

із виду *Alternaria*, наприклад, *Alternaria brassicae*,

із виду *Pseudocercospora*, наприклад, *Pseudocercospora herpotrichoides*

Добра переносність рослинами активних речовин згідно з винаходом у концентраціях, необхідних для подолання хвороб рослин, дозволяє здійснювати обробку наземних частин рослин, саджанців та насіння, а також ґрунту

При цьому активні речовини згідно з винаходом з особливим успіхом можуть бути застосовані для боротьби із захворюваннями злакових, наприклад, проти видів *Erysiphe*, *Fusarium*, *Pseudocercospora* та *Puccinia*, або захворювань у виноградарстві, садівництві та овочівництві, наприклад, проти видів *Venturia*, *Sphaerotheca*, *Phytophthora*, *Plasmopara*, або також захворювань рису, наприклад, із виду *Pyricularia*. Крім того, винайдені активні речовини мають дуже сильну і широку ефективність *in vitro*

При цьому активні речовини з добрим успіхом придатні для боротьби із захворюваннями зернових, наприклад, проти видів *Erysiphe*, *Fusarium*, *Pseudocercospora* та *Puccinia*, або проти захворювань у виноградарстві, садівництві та овочівництві, таких, наприклад, як види *Venturia*, *Sphaerotheca*, *Phytophthora* та *Plasmopara*, або також захворювань рису, таких як *Pyricularia*. Крім того, активні речовини згідно з винаходом мають дуже сильну і широку ефективність *in vitro*. В залежності від фізичних та/або хімічних властивостей, активні речовини можуть бути переведені в звичайні препаратні форми, такі як розчини, емульсії, суспензії, порошки, піни, паста, гранули, аерозолі, мікрокап-

сули в полімерних оболонках, покривні маси для посівного матеріалу, а також форми для обробки холодним та теплим туманом в ультрамалому об'ємі

Ці препаративні форми можуть бути одержані відомим чином, наприклад, шляхом змішування активних речовин з наповнювачами, тобто рідкими розчинниками та/або твердими носіями, при необхідності з використанням поверхнево-активних засобів, тобто емульгаторів та/або диспергаторів та/або піноутворюючих засобів. В разі використання води як наповнювача допоміжними розчинниками можуть бути також органічні розчинники. Як рідкі розчинники придатні ароматичні речовини, такі як ксилол, толуол, або алкілнафтаїни, хлоровані ароматичні речовини та хлоровані аліфатичні вуглеводні, такі як хлорбензол, хлоретилен або метиленхлорид, аліфатичні вуглеводні, такі як циклогексан або парафіни, наприклад, фракції нафти, мінеральні та рослинні масла, спирти, такі як бутанол або гліколь, а також їх прості та складні ефіри, кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, метил ізобутилкетон або циклогексанон, сильно полярні розчинники, такі як диметилформамід та диметилсульфоксид, а також вода. Під зрідженими газоподібними наповнювачами або носіями маються на увазі рідини, які при нормальній температурі та нормальному тиску перебувають у газоподібній формі, наприклад, аерозольні газиносії, такі як галогеновуглеводні, а також бутан, пропан, азот та діоксид вуглецю. Як тверді речовини-носії придатні мука природних порід, таких як каолін, глиноземи, тальк, крейда, кварц, атапульгіт, монтморилоніт або діатомна земля та мука штучних твердих матеріалів, таких як високодисперсні кислоти кремнію, оксид алюмінію та силікати, як тверді речовини-носії для грануляту беруться до уваги наприклад, подрібнені та фракціоновані природні породи, такі як кальцит, мармур, пемза, сепіоліт, доломіт, а також синтетичні грануляти із неорганічної та органічної муки, а також грануляти із органічного матеріалу, такого як стружка деревини, оболонки кокосових горіхів, початки кукурудзи та стебла тютюну, як емульгуючі та піноутворюючі засоби беруться до уваги наприклад, неіоногенні та аніонні емульгатори, такі як поліоксиетиленові ефіри жирних кислот, поліоксиетиленові ефіри жирних спиртів, наприклад, алкіларилгліколевий ефір, алкілсульфонати, алкілсульфати, арилсульфонати, а також гідролізати білків, як диспергуючі засоби беруться до уваги наприклад, випущений сульфат лігніну та метилцелюлоза. У згаданих препаративних формах застосовують при необхідності активатори прилипання, такі як карбоксиметилцелюлоза, природні та штучні, порошкоподібні, зернисті чи латексоподібні полімери, такі як гуміарабік, полівініловий спирт, полівінілацетат, а також природні фосфоліпіди, такі як кефаліни та лецитини та штучні фосфоліпіди. Іншими можливими домішками є мінеральні та рослинні масла.

При необхідності додаються фарбники, такі як неорганічні пігменти, наприклад, оксид заліза, оксид титану, фероціановий блакитний та органічні фарбники, такі як алізарин-, азо- та металфталоціанінові фарбники, а також мікроелементи і живи-

льні речовини, такі як солі заліза, марганцю, бору, міді, кобальту, молібдену та цинку

Препаративні форми містять в загальному випадку масову частку активної речовини від 0,1 до 95 %, переважно від 0,5 до 90%

Активні речовини згідно з винаходом можуть бути застосовані як такі або у суміші з відомими фунгіцидами, бактерицидами, акарицидами, нематодіцидами або інсектицидами з метою розширення спектру дії або запобігання виробленню стійкості. В багатьох випадках спостерігають синергійний ефект, коли ефективність суміші вища, ніж сумарна ефективність окремих складових.

Особливо придатними партнерами для змішування є

Фунгіциди

2-амінобутан, 2-аніліно-4-метил-6-циклопропіл-піримідин, 2',6'-дибромо-2-метил-4'-трифтор-метокси-4'-трифторо-метил-1,3-тіазол-5-карбоксамід, 2,6-дихлоро-N-(4-трифторметил-бензил)бензамід, (E)-2-метоксиіміно-N-метил-2-(2-феноксифеніл)-ацетамід, 8-гідроксиквінолінсульфат, метил-(E)-2-{2-[6-(2-ціано-феноксипіримідин-4-ілокси)феніл]-3-метоксиакрилат, метил-(E)-метоксиіміно[альфа-(o-топілокси)-o-топіл] ацетат, 2-фенілфенол (OPP), алдіморф, ампропілфос, анілазін, азокназол, беналаксил, беноданіл, беноміл, бінапакрил, біфеніл, бітертанол, бластицидин-S, бромукназол, бупірімат, бутіобати, полісульфід кальцію, каптафол, каптан, карбендазім, карбоксин, хінометонат (квінометонат), хлорнеб, хлоропікрин, хлороталоніл, хлосолінат, куфранеб,

кімоксаніл, кіпроконазоли, кіпрофурам, дихлорофен, диклобутразол, диклофлуанід, дикломецин, диклоран, діетофенкарб, дифенокназол, диметірімол, диметоморф, динконазол, динокап, дифеніламін, дипіртіон, диталіміфос, дитіанон, додин, дразоксолон, едіфенфос, епоксіконазоли, етірімол, етрідіазол,

фенарімол, фенбуконазоли, фенфурам, фенітропан, фенпіціоніл, фенпропідин, фенпропіморф, фентінацетати, фентінігідроксид, фербам, ферімізони, флазінам, флудіоксоніл, фтороміди, флуквіконазоли, флуцілазоли, флусульфаміди, флутолани, флутриафол, фолпет, фоцетил-алюмініум, фталіди, фуберідазол, фуралаксил, фурумециклокс,

гуазатини, гексахлоробензол, гексакназол, пмексазол, імазапіл, імібенконазол, іміноктадин, іпробенфос (IBP), іпродіон, ізопротіопан, касугаміцин, препарати на основі міді, такі як гідроксид міді, нафтенат міді, оксихлорид міді, сульфат міді, оксид міді, оксин міді та бордоська суміш,

манкоппер, манкозєб, манєб, мепаніпірім, мепроніл, металаксил, метконазол, метасульфоккарб, метфуросам, метрам, метсульфовакс, міклобутаніл, диметилдитіокарбамат нікелю, нитроталізопропіл, нуаріомол, офурази, оксидиксил, оксамокарб, оксикарбоксин,

пєфуразоат, пенконазол, пенцикурон, фосдіфен, пімаріцин, піпералін, поліоксин, пробеназол, прохлораз, процимідон, пропамокарб, пропікона-

золи, пропінеб, піразофос, піріфенокс, піріметаніл, піроквілон,

квінтозен (PCNB),

сірка та препарати на основі сірки,

тебуконазол, теклофталам, текназен, тетраконазол, табендазол, тіціофен, тіофанат-метил, тірам, толхлофос-метил, толілфлуанід, триадімефон, триадіменол, триазоксид, трихіамід, трициклазол, тридеморф, трифлумізол, трифорін, тритіконазол,

валідаміцин А, вінклозолін,

зінеб, зірам

Бактерициди

Бронопол, дихлорофен, нитрапірин, диметилдитіокарбамат нікелю, касугаміцин, октілінон, фуранкарбонова кислота, окситетрациклін, пробеназол, стрептоміцин, теклофталам, сульфат міді та інші препарати на основі міді

Інсектициди / Акарициди / Нематодіциди

Абамектин, AC 303 630, ацефат, акрінатрин, аланікарб, алдікарб, альфаметрин, ампрез, аверместин, AZ 60541, азадірахтин, азінфос А, азінфос М, азокілотин,

basillus thuringiensis, бендіокарб, бенфуракарб, бенсультап, бетацифлутрин, біфентрин, BPMC, брофенпрокс, бромфос А, буфенкарб, бупрофенцін, бутіокарбоксин, бутілпіридабен,

кадусафос, карбарил, карбофуран, карбофенотіон, карбосульфат, картап, CGA 157 419, CGA 184699, хлоетокарб, хлоретоксифос, хлорфенвінфос, хлорфлуазурон, хлормефос, хлорпіріфос, хлорпіріфос М, ціс-ресметрин,

клоцитрин, клофентецин, ціанофос, циклопро-трин, цифлутрин, цигалотрин, цигексатін, ципен-нетрин, циромацін,

дептаметрин, деметон М, деметон S, деметон-S-метил, діафентіурон, діазінон, дихлофентіон, дихлорвос, дикліфос, дикротофос, діетіон, дифлубензурон, диметоат, диметилвінфос, діоксатіон, дисульфотон,

едіфенфос, емаектин, есфенвалерат, етіофенкарб, етіон, етофенпрокс, етопрофос, етофенпрокс, етримфос,

фенаміфос, феназаквін, фенбутатіноксид, феніпротіон, фенобукарб, фенотіокарб, феноксикарб, фенпропатрин, фенпірад, фенпроксимат, фентіон, фенвалерати, фіпроніл, флазінам, флуціклоксурон, флуцитринат, флуфеноксурон, флуфенпрокс, флувалінати, фонофос, формотіон, фостіазат, фубфенпрокс, фураціокарб,

НСН, гептенофос, гексафлумурон, гекситіа-зокс,

імідаклопрід, іпробенфос, ізазофос, ізофенфос, ізопрокарб, ізоксатіон, івемектин,

лямбда-цигалотрин, луфенурон,

малатіон, мекарбам, мервінфос, месульфенфос, метальдепід, метакріфос, метамідофос, метідатіон, метіокарб, метоміл, метолкарб, мілбемектин, монокротофос, моксидектин,

налед, NC 184, NI 25, нітенпірам

ометоат, оксаміл, оксидеметон М, оксидепро-фос,

паратіон А, паратіон М, перметрин, фентоат, форат, фосалон, фосмет, фосфамдон, фоксім, пірімікарб, піріміфос М, піріміфос А, профенофос, профенофос, промекарб, пропафос, пропоксур,

протіофос, протіофос, протіоат,
піметроцин, пірахлофос, піраклофос, піракло-
пос, пірадафентіон, піресметрин, піретрум, пірада-
бен, піримідифен, піпроксифен,
квіналфос,
RH 5992,
салпін, себуфос, сілафлуофен, сульфотеп,
сулпрофос,
тебуфеноцид, тебуфенпірад, тебупірімфос,
тефлубензурон, тефлутрин, темефос, тербам,
тербуфос, тетрахлорвінфос, тіафенокс, тіодикарб,
тіофанокс, тіометон, тіонацин, туріпензін, трало-
метрин, триаратен, триазофос, триазурон, трих-
лорфон, трифлумурон, триметакарб,
вамідотіон, ХМС, ксилілкарб, цетаметрин

Активні речовини згідно з винаходом можуть
бути змішані також з іншими відомими активними
речовинами, такими як гербіциди, або добривами
та регуляторами росту рослин

Активні речовини згідно з винаходом можуть
бути застосовані як такі, у формі їх наявних у про-
дажу композицій або приготовлених із них форм
застосування, таких як готові до застосування роз-
чини, суспензії, порошки для розприскування, пас-
ти, розчинні порошки, пілоподібні засоби та гра-
нули Застосування здійснюють звичайним чином,
наприклад, шляхом поливання, обприскування,
обсипання, опінення і т.п. Крім того, активні речо-
вини можна застосовувати для методу обробки в
ультрамалому об'ємі або вносити активні речови-
ни чи препарати із них у ґрунт. Ними можна також
обробляти посадковий матеріал рослин

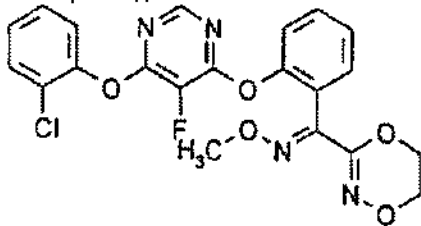
При обробці частин рослин концентрацію ак-
тивної речовини в формах застосування можна
змінювати в широких межах, її масова частка може
становити від 1 до 0,0001%, переважно від 0,5 до
0,001%

При обробці посівного матеріалу використо-
вують в загальному випадку від 0,001 до 50г акти-
вної речовини на 1кг посівного матеріалу, перева-
жно від 0,01 до 10г

При обробці ґрунту масова частка активної речо-
вини в місці внесення становить від 0,00001 до
0,1%, переважно від 0,0001 до 0,02%

Приклади одержання

Приклад 1



Спосіб а)

До суміші 135,3г (0,56моль) 3-[1-(2-
гідроксифеніл)-1-(метокаміно)-метил]-5,6-дигідро-
1,4,2-діоксазину та 197,6г подрібненого карбонату
калію в 480мл ацетонітрилу додавали при 20°C за
один раз 136,8г (0,56моль) 4-(2-хлорфенокси)-5,6-
дифторпіримідину, причому температура зростала
до 31°C. Ще протягом 6 годин перемішували при
температурі 50°C, а потім протягом ночі без піді-
грівання, причому суміш охолоджувалась. Реак-
ційну суміш виливали до 2,3л льодяної води і пе-
ремішували 5 годин, причому викристалізовувався

продукт. Його відсмоктували і порціями промивали
водою в кількості 0,57л

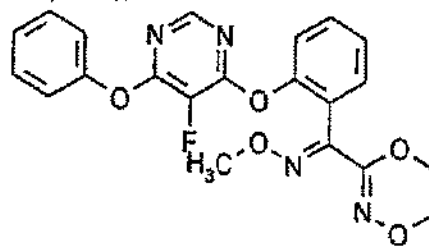
Одержували 260г (97,8% від теоретичного) 3-[1-(2-
гідроксифеніл)-2-метоксиетен-1-іл]-5,6-дигідро-
1,4,2-діоксазину та 0,6г (0,00288моль) 4-фенокси-
5,6-дифторпіримідину в 10мл диметилформаміду
додавали при 0°C 0,119г гідриду натрію (60%-су-
спензія в мінеральному маслі) і перемішували 12
годин при 20°C. Реакційну суміш виливали на воду
і екстрагували етиловим ефіром оцтової кислоти.
Очищені органічні фази сушили над сульфатом
натрію і згущували при зниженому тиску. Зали-
шок хроматографували на силікагелі із сумішшю
циклогексан/ефір оцтової кислоти (1 : 1). Одержу-
вали 0,4г (82% від теоретичного) 3-[1-(2-(4-
фенокси-5-фторпіримід-6-ілокси)-феніл]-2-
метоксиетен-1-іл]-5,6-дигідро-1,4,2-діоксазину

Приклад 2

Спосіб а)

До розчину 0,7г (0,00298моль) 3-[1-(2-
гідроксифеніл)-2-метоксиетен-1-іл]-5,6-дигідро-
1,4,2-діоксазину та 0,6г (0,00288моль) 4-фенокси-
5,6-дифторпіримідину в 10мл диметилформаміду
додавали при 0°C 0,119г гідриду натрію (60%-су-
спензія в мінеральному маслі) і перемішували 12
годин при 20°C. Реакційну суміш виливали на воду
і екстрагували етиловим ефіром оцтової кислоти.
Очищені органічні фази сушили над сульфатом
натрію і згущували при зниженому тиску. Зали-
шок хроматографували на силікагелі із сумішшю
циклогексан/ефір оцтової кислоти (1 : 1). Одержу-
вали 0,4г (82% від теоретичного) 3-[1-(2-(4-
фенокси-5-фторпіримід-6-ілокси)-феніл]-2-
метоксиетен-1-іл]-5,6-дигідро-1,4,2-діоксазину
¹H-ЯМР-спектр (CDCl₃/TMS) δ = 3,678 (3H),
4,056/4,069/4,083 (2H), 4,300/4,314/4,328 (2H),
6,891 (1H), 7,199 - 7,475 (9H), 8,063 (1H) млн⁻¹

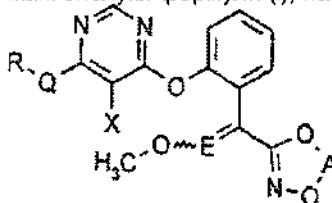
Приклад 3



Спосіб б)

Суміш 124,1г (0,333 моль) 3-[1-(2-(4,5-
дифторпіримід-6-ілокси)-феніл]-1-(метоксіміно)-
метил]-5,6-дигідро-1,4,2-діоксазину, 31,3г
(0,333моль) фенолу, 46г (0,333моль) карбонату
калію, а також 3,3г хлориду міді (І) в 1л диметил-
формаміду перемішували протягом ночі при
100°C. Після охолодження до 20°C розчинник від-
ганяли при зниженому тиску. Залишок змішували
з етиловим ефіром оцтової кислоти і кілька разів
промивали водою. Органічну фазу сушили над
сульфатом натрію і знову згущували при знижено-
му тиску. Залишок хроматографували на силіка-
гелі з розчинником гексан/ацетон (7 : 3). Одержу-
вали 112,4г (97% від теоретичного) 3-[1-(2-(4-
фенокси-5-фторпіримід-6-ілокси)-феніл]-1-
(метоксіміно)-метил]-5,6-дигідро-1,4,2-діоксазину з
точкою плавлення 110°C

Аналогічно прикладам 1 - 3, а також відповідно
до даних в загальному описі способу, були одер-
жані сполуки формули (І), наведені в таблиці 1



(І)

Таблица 1

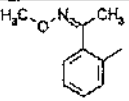
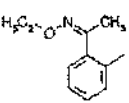




№ присл	R	Q	X	E	A	Физич. дан.
4		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
5		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
6		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	Тр 135°C
7		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
8		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
9		S	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)

Таблица 1, продолжения




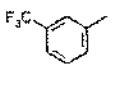
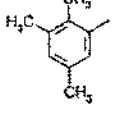

№ присл	R	Q	X	E	A	Физич. дан.
10		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
11		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
12		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
13		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
14		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
15		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)

Таблица 1, продолжения





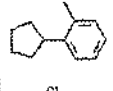


№ присл	R	Q	X	E	A	Физич. дан.
16		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)
17		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
18		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)
19		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)
20		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
21		NH	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
22		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)

Таблица 1, продолжения



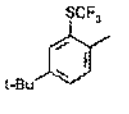

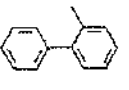
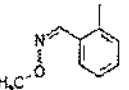
№ присл	R	Q	X	E	A	Физич. дан.
23		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
24		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
25		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
26		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
27		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.70 (s, 3H)
28		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)

Таблица 1, продолжение

№ прикл.	R	Q	X E A	Физич. данн.
29		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
30		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)
31		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
32		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)
33		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.75 (s, 3H)
34		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)

Таблица 1, продолжение

№ прикл.	R	Q	X E A	Физич. данн.
35		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.90 (s, 3H)
36		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)
37		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)
38		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)
39		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
40		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)

Таблица 1, продолжение

№ прикл.	R	Q	X E A	Физич. данн.
41		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
42		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)
43		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
44		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
45		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)
46		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
47		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)

Таблица 1, продолжение

№ прикл.	R	Q	X E A	Физич. данн.
48		-CH ₂ O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)
49		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)
50		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
51		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	Тп 168°C
52		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	Тп 192°C
53		-CH ₂ O-	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
54		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)

Таблица 1. продолжения

№ прим.	R	Q	X E A	Физич. дан.
55		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
56		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
57		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
58		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)
59		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)
60		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)

Таблица 1. продолжения

№ прим.	R	Q	X E A	Физич. дан.
61		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
62		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
63		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)
64		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
65		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
66		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.80 (s, 3H)

Таблица 1. продолжения

№ прим.	R	Q	X E A	Физич. дан.
67		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
68		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
69		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.70 (s, 3H)
70		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.75 (s, 3H)
71		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
72		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.75 (s, 3H)

Таблица 1. продолжения

№ прим.	R	Q	X E A	Физич. дан.
73		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
74		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
75		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
76		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
77		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)
78		O	F N -CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР* 3.85 (s, 3H)

Таблица 1. продолжения

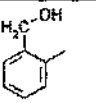
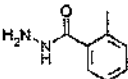
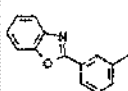
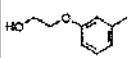
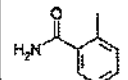
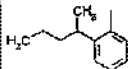
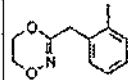
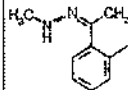




№ прил.	R	Q	X	E	A	Физич. дан.
79		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР * 3 85 (s, 3H)
80		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР * 3 85 (s, 3H)
81		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР * 3 80 (s, 3H)
82		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР * 3 90 (s, 3H)
83		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	Тр >200°C
84		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР * 3 85 (s, 3H)

Таблица 1. продолжения

№ прил.	R	Q	X	E	A	Физич. дан.
85		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР * 3 85 (s, 3H)
86		O	F	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР * 3 85 (s, 3H)
87		O	Cl	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР * 3 85 (s, 3H)
88		O	Cl	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР * 3 90 (s, 3H)
89		O	Cl	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР * 3 85 (s, 3H)
90		O	Cl	N	-CH ₂ -CH ₂ -	ЯМР * 3 85 (s, 3H)

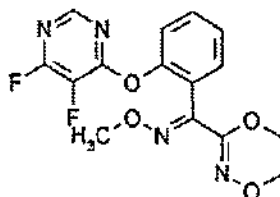
Приклад	R	Q	X	Y ¹	Фізичні дані
III-2		O	F	F	T _{пл} 91°C/0,6 мбар Log P 3 20
III-3		O	F	F	Log P 3 74
III-4		O	F	F	Log P 3 32
III-5		O	F	F	Log P 3 66
III-6		O	F	F	
III-7		O	F	F	
III-8		O	F	F	

Приклад	R	Q	X	Y ¹	Фізичні дані
III-9		O	F	F	
III-10		O	F	F	
III-11		O	F	F	
III-12		O	F	F	
III-13		O	F	F	
III-14		O	F	F	
III-15		O	F	F	

Приклад	R	Q	X	Y ¹	Фізичні дані
III-16		O	F	F	
III-17		O	F	F	
III-18		O	F	F	
III-19		O	F	F	
III-20		O	F	F	
III-21		S	F	F	

Одержання вихідних сполук формули (IV)

Приклад (IV-1)



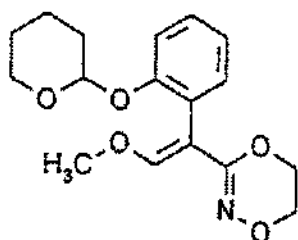
Спосіб b-1)

До розчину 47,2г (0,2моль) 3-[1-(2-гідроксифеніл)-1-(метоксіміно)-метил]-5,6-дигідро-1,4,2-діоксазин (WO-A 9504728) в 1л тетрагідрофурану при 0°C малими порціями додавали спочатку 29,3г (0,22моль) 4,5,6-трифторпіримідину, а потім 6,0г (0,2моль) гідриду натрію (80-% суспензія в мінеральному маслі). Суміш перемішували протягом 3 годин при 0°C, а потім протягом ночі без подальшого охолодження. Залишок розчиняли етиловим ефіром оцтової кислоти і кілька разів промивали водою. Органічну фазу сушили над сульфатом натрію і знову згущували при зниженому тиску, причому в залишку одержували в'язку маслянисту речовину, яка повільно кристалізується. Одержували 68,7г (98% від теоретичного) 3-[1-(2-(4,5-дифторпіримід-6-ілокси)-феніл)-1-(метоксіміно)-метил]-5,6-дигідро-1,4,2-діоксазину з точкою плавлення 98°C.

Аналогічно прикладові (IV-1) одержували 3-[1-(2-(5-хлор-4-фторпіримід-6-ілокси)-феніл)-1-(метоксіміно)-метил]-5,6-дигідро-1,4,2-діоксазин, приклад (IV-2) у вигляді в'язкої маслянистої речовини.

¹H-ЯМР-спектр (CDCl₃/TMS) δ = 3,80 (s, 3H) млн⁻¹

Одержання проміжного продукту формули (VI)
Приклад (VI-1)

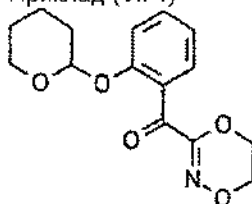


Спосіб а-2)

Суміш 31,2г (0,091моль) метоксиметилентрифеніл-фосфоніум-хлориду і 10,2г (0,091моль) трет-бутилату калію в 100мл тетрагідрофурану протягом 20 хвилин перемішували при 20°C. Потім додавали розчин 13,3г (0,0457моль) 3-[2-(тетрагідропіран-2-ілокси)-бензоіл]-5,6-дигідро-1,4,2-діоксазину в 100мл тетрагідрофурану і нагрівали 12 годин зі зворотним потоком до кипіння. Суміш згущували і розподіляли залишок між водою і етиловим ефіром оцтової кислоти. Органічну фазу відокремлювали і сушили над сульфатом натрію. Залишок хроматографували сумішшю циклогексан/ефіру оцтової кислоти (1 : 1) на силікагелі. Одержували 9,2г (63% від теоретичного) 3-[1-[2-(тетрагідропіран-2-ілокси)-феніл]-2-метоксиетен-1-іл]-5,6-дигідро-1,4,2-діоксазину.

¹H-ЯМР-спектр (CDCl₃/TMS) δ = 1,5 - 1,92 (6H), 3,5 - 4,0 (2H), 3,730 (3H), 4,056 - 4,111 (2H), 4,295 - 4,325 (2H), 5,410/5,420 (1H), 6,963 (1H), 6,950 - 7,461 (4H) млн¹.

Одержання проміжного продукту формули (VII)
Приклад (VII-1)



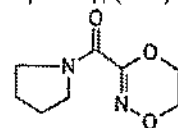
Спосіб а-3)

5г (0,0193моль) 1-(тетрагідропіран-2-ілокси)-2-бромбензолу (Synthesis 1987, стор 951) розчиняли в 20мл тетрагідрофурану і охолоджували до -40°C. При цій температурі краплями додавали 10,8г (0,0388моль) n-бутиллітію (23% розчин в гексані), потім 50%-розчин 7,2г (0,0195моль) 1-(5,6-дигідро-1,4,2-діоксазин-3-іл)-1-(піролідін-1-іл)-метанон в тетрагідрофурані і перемішували 10 хвилин при -40°C. Потім краплями додавали розчин 4,2г (0,0785моль) хлориду амонію в 25мл води, змішували з діетиловим ефіром, відокремлювали органічну фазу і кілька разів екстрагували водну фазу діетиловим ефіром. Очищені органічні фази сушили над сульфатом натрію і згущували при зниженому тиску. Залишок кристалізувався при розтиранні з пентаном. Кристали двічі відфільтровували і промивали 5 мл піпетрами діізопропілового ефіру. Одержували 2,4г (35,8% від теоретичного) 3-[2-(тетрагідропіран-2-ілокси)-бензоіл]-5,6-дигідро-1,4,2-діоксазину (84% вміст за хроматографічним аналізом).

¹H-ЯМР-спектр (CDCl₃/TMS) δ = 1,565 - 1,954 (6H), 3,54 - 3,68 (1H), 3,78 - 4,0 (1H), 4,154 - 4,354 (2H), 4,448 - 4,510 (2H), 5,512 (1H), 7,004 - 7,056 (1H), 7,199/7,227 (1H), 7,408 - 7,463 (2H) млн¹.

Одержання проміжного продукту формули (IX)

Приклад (IX-1)



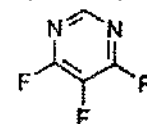
Спосіб а-4)

Розчиняли 44,9г (0,8моль) гідроксиду калію в 107мл метанолу і 27,8г (0,4моль) хлориду гідроксиламонію в 180мл метанолу, об'єднували обидва розчини при 35°C - 40°C. Потім додавали при 10 - 20°C 34,2г (0,2моль) етилового ефіру оксопіролідін-1-іл-оцтової кислоти (EP-A 469889) і перемішували 30 хвилин при 20°C. Потім додавали 27,6г (0,2моль) карбонату калію і 169,1г (0,9моль) диброметану і кип'ятили 4 години зі зворотним потоком. Відфільтровували від солі, фільтрат згущували при зниженому тиску, залишок розчиняли в 600мл етилового ефіру оцтової кислоти і органічну фазу послідовно промивали 50мл насиченого водного розчину хлориду натрію і 50мл напівнасиченого водного розчину хлориду натрію. Органічну фазу сушили над сульфатом натрію, розчинник відганяли у вакуумі, а на останок при глибокому вакуумі 2 тор і 60°C. Одержували 20,9г (52,2% від теоретичного) 1-(5,6-дигідро-1,4,2-діоксазин-3-іл)-1-(піролідін-1-іл)-метанон (92% вміст за хроматографічним аналізом).

¹H-ЯМР-спектр (CDCl₃/TMS) δ = 1,841 - 1,978 (4H), 3,491 - 3,547 (2H), 3,709 - 3,793 (2H), 4,166 - 4,194 (2H), 4,460 - 4,487 (2H) млн¹.

Одержання проміжного продукту формули (XIII)

Приклад (XIII-1)



Із суміші 609г фториду калію в 2,3л сульфолану відганяли 500мл рідини при 145°C і 20мбар. Потім додавали 1054г 5-хлор-4,6-дифторпіримідину (DE-A 3843558) і 25г тетрафенілфосфоній-броміду, створюють атмосферу азоту з тиском 5бар і перемішують 24 години при 240°C, причому тиск збільшують до 11бар. Реакційну суміш охолоджують до 80°C і знімають тиск. Потім суміш при нормальному тиску повільно нагрівають, причому продукт відганяють. Коли температура зумпфу досягала 200°C, тиск знижували до 150мбар, щоб прискорити відгонку і одержання продукту. Загалом одержували 664г (70,7% від теоретичного) 4,5,6-трифторпіримідину з точкою кипіння 86 - 87°C.

Приклади застосування

Приклад А

Тест на захист томатів від Phytophthora

Розчинник 4,7 масових частки ацетону

Емульгатор 0,3 масових частки алкіларилполігліколевого ефіру

Для одержання бажаного препарату активної речовини змішували 1 масову частку активної речовини із вказаною кількістю розчинника і емульгатора і концентрат розводили водою до потрібної концентрації.

Для перевірки захисної дії молоді рослини об-

прискували препаратом активної речовини. Після висихання роси рослини заражали водною суспензією спор *Phytophthora infestans*.

Рослини поміщали в інкубаційну камеру з відносною вологістю повітря 100% і температурою близько 20°C.

Через 3 дні після інкуляції здійснювали оцінку.

В цьому тесті сполуки прикладів одержання (1), (2), (3), (6), (8), (10), (17), (40), (41), (43), (47), (49), (55), (63), (76), (77) та (78) при концентрації активної речовини 100 млн¹ проявили ефективність більшу, ніж 90%.

Приклад В

Тест на захист винограду від *Plasmopara*

Розчинник 4,7 масових частки ацетону

Емульгатор 0,3 масових частки алкіларилполігліколевого ефіру

Для одержання бажаного препарату активної речовини змішували 1 масову частку активної речовини із вказаною кількістю розчинника і емульгатора і концентрат розводили водою до потрібної концентрації.

Для перевірки захисної дії молоді рослини обприскували препаратом активної речовини. Після висихання роси рослини заражали водною суспензією спор *Plasmopara viticola*, а потім залишали на 1 день у камері вологості при 20 - 22°C та відносній вологості повітря 100%. Після цього рослини 5 днів витримували в теплиці при 21°C відносній вологості повітря близько 90%. Потім рослини зволожували і 1 день тримали в камері вологості.

Через 6 днів після інкуляції здійснювали оцінку.

В цьому тесті сполуки прикладів одержання (1), (2), (3), (4), (5), (6), (8), (10), (11), (14), (15), (16), (17), (18), (22), (23), (26), (28), (32), (33), (38), (39), (40), (41), (43), (45), (47), (48), (49), (53), (55), (63), (76), (77) і (78) при концентрації активної речовини 100 млн¹ показали ефективність до 100%.

Приклад С

Тест на захист огірків від *Sphnerotheca*

Розчинник 4,7 масових частки ацетону

Емульгатор 0,3 масових частки алкіларилполігліколевого ефіру

Для одержання бажаного препарату активної речовини змішували 1 масову частку активної речовини із вказаною кількістю розчинника і емульгатора і концентрат розводили водою до потрібної концентрації.

Для перевірки захисної дії молоді рослини обприскували препаратом активної речовини. Після висихання роси рослини посипали кондіями грибка *Sphaerotheca fuliginea*.

Рослини виставляли в теплицю при 23 - 24°C і відносній вологості повітря близько 75%. Через 10 днів після інкуляції здійснювали оцінку.

В цьому тесті сполуки прикладів одержання (1), (2), (3), (8), (10), (13), (15), (17), (22), (23), (26), (28), (32), (37), (41), (47), (48) і (49) при концентрації активної речовини 100 млн¹ показали ефективність до 100%.

Приклад D

Тест на захист яблук від *Venturia*

Розчинник 4,7 масових частки ацетону

Емульгатор 0,3 масових частки алкіларилпо-

лігліколевого ефіру

Для одержання бажаного препарату активної речовини змішували 1 масову частку активної речовини із вказаною кількістю розчинника і емульгатора і концентрат розводили водою до потрібної концентрації.

Для перевірки захисної дії молоді рослини обприскували препаратом активної речовини. Після висихання роси рослини інкулювали водною суспензією конідій збудника яблучної парші *Venturia inaequalis* і залишали на 1 день при 20°C і відносній вологості повітря 100% в інкубаційній камері.

Потім рослини виставляли в теплицю при 20°C і відносній вологості повітря близько 70%.

Через 12 днів після інкуляції здійснювали оцінку.

В цьому тесті сполуки прикладів одержання (1), (2), (3), (4), (5), (6), (8), (10), (11), (13), (14), (15), (16), (17), (18), (22), (26), (28), (32), (33), (37), (38), (39), (41), (43), (45), (47), (48), (49), (53), (55), (63), (77) і (78) при концентрації активної речовини 10 млн¹ показали ефективність до 100%.

Приклад Е

Тест на захист ячменю від *Erysiphe*

Розчинник 10 масових часток N-метилпропілону

Емульгатор 0,6 масових частки алкіларилполігліколевого ефіру

Для одержання бажаного препарату активної речовини змішували 1 масову частку активної речовини із вказаною кількістю розчинника і емульгатора і концентрат розводили водою до потрібної концентрації.

Для перевірки захисної дії обприскували молоді рослини препаратом активної речовини у вказаній кількості.

Після висихання роси рослини посипали спорами *Erysiphe graminis f. sp. hordei*.

Рослини поміщали в теплицю при температурі близько 20°C і відносній вологості повітря близько 80% з метою створення сприятливих умов для розвитку спор.

Через 7 днів після інкуляції здійснювали оцінку.

В цьому тесті, наприклад, сполука (59) при кількості активної речовини 250г/га показала ефективність 100% порівняно з необробленою контрольною групою.

Приклад F

Тест на лікування ячменю від *Erysiphe*

Розчинник 10 масових часток N-метилпропілону

Емульгатор 0,6 масових частки алкіларилполігліколевого ефіру

Для одержання бажаного препарату активної речовини змішували 1 масову частку активної речовини із вказаною кількістю розчинника і емульгатора і концентрат розводили водою до потрібної концентрації.

Для перевірки лікувальної дії молоді рослини обприскували спорами *Erysiphe graminis f. sp. hordei*. Через 48 годин після інкуляції рослини обприскували препаратом активної речовини у вказаній кількості. Рослини поміщали в теплицю при температурі близько 20°C і відносній вологості повітря близько 80% з метою створення сприятли-

вих умов для розвитку спор

Через 7 днів після інокуляції здійснювали оцінку

В цьому тесті сполуки прикладів одержання (I) (6) при кількості застосованої активної речовини 250г/га показали ефективність 100% порівняно з необробленою контрольною групою

Приклад G

Тест на захист пшениці від *Fusarium nivale* (var *maius*)

Розчинник 10 масових часток N-метилпропілону

Емульгатор 0,6 масових частки алкіларилполігліколевого ефіру

Для одержання бажаного препарату активної речовини змішували 1 масову частку активної речовини із вказаною кількістю розчинника і емульгатора і концентрат розводили водою до потрібної концентрації

Для перевірки захисної дії молоді рослини обробляли препаратом активної речовини у вказаній кількості

Після висихання препарату рослини обприскували суспензією конідій *Fusarium nivale* var *maius*

Рослини поміщали в теплицю зі світлопроникним ковпаком при температурі близько 15°C і відносній вологості повітря близько 100%

Через 4 дні після інокуляції здійснювали оцінку

В цьому тесті сполуки прикладів одержання (8), (11), (14), (15), (24), (33), (41), (42) і (55) при кількості застосованої активної речовини 250г/га показали ефективність 100% порівняно з необробленою контрольною групою

Приклад H

Тест на лікування пшениці від *Fusarium nivale*

Розчинник 10 масових часток N-метилпропілону

Емульгатор 0,6 масових частки алкіларилполігліколевого ефіру

Для одержання бажаного препарату активної речовини змішували 1 масову частку активної речовини із вказаною кількістю розчинника і емульгатора і концентрат розводили водою до потрібної концентрації

Для перевірки лікувальної дії молоді рослини обприскували суспензією конідій *Fusarium nivale* var *maius*

Рослини залишали на 24 годин при 15°C і відносній вологості повітря 100% в інкубаційній камері. Потім обприскували рослини препаратом активної речовини у вказаній кількості

Після висихання препарату рослини поміщали в теплицю зі світлопроникним інкубаційним ковпаком при температурі близько 15°C і відносній вологості повітря близько 100%

Через 4 дні після інокуляції здійснювали оцінку

В цьому тесті, наприклад, сполука із прикладу (43) при кількості застосованої активної речовини 250г/га показала ефективність 100% порівняно з необробленою контрольною групою

Приклад I

Тест на захист пшениці від *Fusarium nivale* (var *nivale*)

Розчинник 10 масових часток N-метил-

пропілону

Емульгатор 0,6 масових частки алкіларилполігліколевого ефіру

Для одержання бажаного препарату активної речовини змішували 1 масову частку активної речовини із вказаною кількістю розчинника і емульгатора і концентрат розводили водою до потрібної концентрації

Для перевірки захисної дії молоді рослини обробляли препаратом активної речовини у вказаній кількості

Після висихання препарату рослини обприскували суспензією конідій *Fusarium nivale* var *nivale*

Після висихання суспензії рослини поміщали в теплицю зі світлопроникним інкубаційним ковпаком при температурі близько 15°C і відносній вологості повітря близько 100%

Через 4 дні після інокуляції здійснювали оцінку

В цьому тесті сполуки прикладів одержання (10), (11), (15), (24), (32), (34), (43) і (55) при кількості застосованої активної речовини 250г/га показали ефективність 100% порівняно з необробленою контрольною групою

Приклад K

Тест на лікування пшениці від *Fusarium nivale* (var *nivale*)

Розчинник 100 масових часток диметилформаміду

Емульгатор 0,25 масових частки алкіларилполігліколевого ефіру

Для одержання бажаного препарату активної речовини змішували 1 масову частку активної речовини із вказаною кількістю розчинника і емульгатора і концентрат розводили водою до потрібної концентрації

Для перевірки лікувальної дії молоді рослини обприскували суспензією конідій *Fusarium nivale* var *nivale*

Рослини залишали на 24 години в інкубаційній камері при 15°C та відносній вологості повітря 100%. Потім рослини обприскували препаратом активної речовини до утворення роси

Після висихання препарату рослини залишали в теплиці під світлопроникним ковпаком при температурі близько 15°C і відносній вологості повітря близько 100%

Через 4 дні після інокуляції здійснювали оцінку

В цьому тесті сполуки прикладів одержання (24), (30), (31), (34) і (43) при кількості застосованої активної речовини 250г/га показали ефективність 100% порівняно з необробленою контрольною групою

Приклад L

Тест на захист пшениці від *Pseudocercospora herpotrichoides*

Розчинник 10 масових часток N-метилпропілону

Емульгатор 0,6 масових частки алкіларилполігліколевого ефіру

Для одержання бажаного препарату активної речовини змішували 1 масову частку активної речовини із вказаною кількістю розчинника і емульгатора і концентрат розводили водою до потрібної концентрації

Для перевірки захисної дії обприскували молоді рослини препаратом активної речовини у вказаній кількості. Після висихання роси рослини інюкулювали спорами *Pseudocercospora herpotrichoides*.

Рослини поміщали в теплицю при температурі близько 10°C і відносній вологості повітря близько 80%.

Через 21 дні після інюкуляції здійснювали оцінку.

В цьому тесті сполуки прикладів одержання (15), (69) та (71) при кількості застосованої активної речовини 250г/га показали ефективність 100% порівняно з необробленою контрольною групою.

Приклад М

Тест на захист пшениці від *Russinia*

Розчинник 10 масових часток N-метилпіролідону

Емульгатор 0,6 масових частки алкіларипполігліколевого ефіру

Для одержання бажаного препарату активної речовини змішували 1 масову частку активної речовини із вказаною кількістю розчинника і емульгатора і концентрат розводили водою до потрібної концентрації.

Для перевірки захисної дії молоді рослини інюкулювали суспензією спор *Russinia recondita* в 0,1-процентному водному розчині агару. Після висихання рослини обприскували препаратом активної речовини у вказаній кількості. Рослини залишали на 24 години в інкубаційну камеру при 20°C і відносній вологості повітря 100%.

Рослини поміщали в теплицю при температурі

близько 20°C і відносній вологості повітря близько 80% для створення сприятливих умов для розвитку спор.

Через 10 днів після інюкуляції здійснювали оцінку.

В цьому тесті, наприклад, сполуки прикладів (6) і (17) при кількості застосованої активної речовини 250г/га показали ефективність 100% порівняно з необробленою контрольною групою.

Приклад N

Тест на захист рису від *Rhizoctonia*

Розчинник 12,5 масових частки ацетону

Емульгатор 0,3 масових частки алкіларипполігліколевого ефіру

Для одержання бажаного препарату активної речовини змішували 1 масову частку активної речовини із вказаною кількістю розчинника і розводили концентрат водою і вказаною кількістю емульгатора до бажаної концентрації.

Для перевірки захисної дії молоді рослини рису обприскували препаратом активної речовини до утворення роси. Через 1 день після висихання препарату рослини заражали водною суспензією спор *Rhizoctonia oryzae*. Потім рослини виставляли в теплиці при температурі 25°C і відносній вологості повітря 100%.

Через 4 дні після інюкуляції здійснювали оцінку ступеню захворювання.

В цьому тесті сполуки прикладів одержання (2), (16), (17), (18), (19), (23), (24), (30), (32), (35), (41) і (48) при концентрації активної речовини 0,05% показали ефективність до 100% порівняно з необробленою контрольною групою.