



УКРАЇНА

(19) UA (11) 76486 (13) C2

(51) МПК (2006)

A01N 43/90

C07D 487/04 (2006.01)

C07D 249/00

C07D 239/00

A01P 3/00

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

(54) 7-АМІНОТРИАЗОЛОПІРИМІДИНИ, СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ, ФУНГІЦИДНИЙ ЗАСІБ НА ЇХ ОСНОВІ ТА СПОСІБ БОРОТЬБИ З ФІТОПАТОГЕННИМИ ГРИБАМИ

1

2

(21) 2004021341

(22) 16.07.2002

(24) 15.08.2006

(86) PCT/EP02/07893, 16.07.2002

(31) 101 36 118.1

(32) 26.07.2001

(33) DE

(46) 15.08.2006, Бюл. № 8, 2006 р.

(72) Тормо І Бласко, ES, Заутер Хуберт, DE, Мюллер Бернд, DE, Геве Маркус, DE, Граммелос Вассіліос, GR, Гроте Томас, DE, Гупсер Андреас, DE, Райнхаймер Йоахим, DE, Розе Інго, DE, Шефер Петер, DE, Шівек Франк, DE, Аммерманн Еберхард, DE, Штратманн Зігфрід, DE, Лоренц Гізела, DE, Штірль Райнхард, DE

(73) БАСФ АКЦІОНЕРНЕ ТОВАРИСТВО, DE

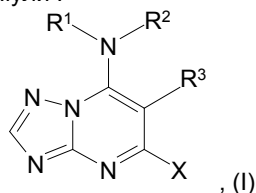
(56) EP 0 613 900, A1, 02.03.1994

US 5 612 345, A, 18.03.1997

WO 9420501, A1, 15.09.1994

RU 2 130 459, C1, 20.05.1999

(57) 1. 7-Амінотриазолопіримідини загальної формули I

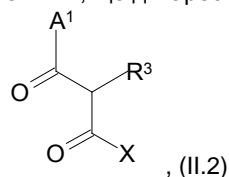
де R¹, R² означає водень, C₁-C₁₀-алкіл, C₂-C₁₀-алкеніл, C₂-C₁₀-алкініл, C₃-C₈-циклоалкіл, феніл, нафтил; або

5- або 6-членний гетероцикліл, який містить від одного до чотирьох атомів азоту або від одного до трьох атомів азоту та один атом сірки або кисню; або

5- або 6-членний гетероарил, який містить від одного до чотирьох атомів азоту або від одного до трьох атомів азоту та один атом сірки або кисню; причому R¹ та R², якщо вони не позначають однаково водень, можуть бути незалежно один від одного частково або цілком галогенованими та/абоможуть мати від одного до трьох залишків із групи R^a, причомуR^a включає ціано, нітро, гідрокси, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галогеналкокси, C₁-C₆-алкілтіо, C₁-C₆-алкіламіно, ді-C₁-C₆-алкіламіно, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-алкенілокси, C₂-C₆-алкініл, C₃-C₆-алкінілокси та необов'язково галогенований оксі-C₁-C₄-алкіленокси; абоR¹ та R² разом з атомом азоту, який їх з'єднує, можуть утворювати 5- або 6-членний цикл, який містить від одного до чотирьох атомів азоту або від одного до трьох атомів азоту та один атом сірки або кисню та який може бути заміщений від одного до трьох залишками із групи R^a;R³ означає C₁-C₁₀-алкіл, C₂-C₁₀-алкеніл, C₂-C₁₀-алкініл, C₃-C₈-циклоалкіл, феніл-C₁-C₁₀-алкіл, причому R³ може бути незаміщеним або частково або цілком галогенованим та/або може мати від одного до трьох залишків із групи R^a, або означає C₁-C₁₀ галогеналкіл, який може мати від одного до трьох залишків із групи R^a;X означає галоген, ціано, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкіл, феніл або заміщений залишком R^a феніл;

а також їхні солі.

2. 7-Амінотриазолопіримідини загальної формули I за п. 1, де X означає галоген.

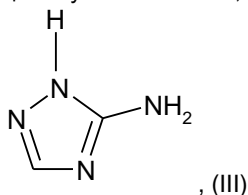
3. Спосіб одержання сполуки формули I за п. 1, де X означає C₁-C₄-галогеналкіл або, у разі потреби, заміщений залишком R^a феніл, який відрізняється тим, що дикарбонільну сполуку формули II.2де A¹ означає C₁-C₁₀-алкокси та X означає C₁-C₄-галогеналкіл або, у разі потреби, заміщений залишком R^a феніл,

(13) C2

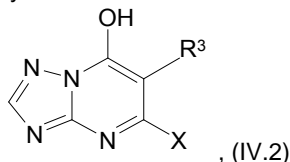
(11) 76486

(19) UA

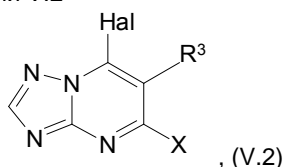
циклізують 3-аміно-1,2,4-триазолом формули III



, (III)
з одержанням 7-гідрокситриазолопіримідину формули IV.2



, (IV.2)
і потім 7-гідрокситриазолопіримідин формули IV.2 галогенують за допомогою агента галогенування з одержанням 7-галогентриазолопіримідину формули V.2



Винахід відноситься до 7-амінотриазолопіримідинів формули I,



де замісники мають наступні значення:

R¹, R² позначає водень, C₁-C₁₀-алкіл, C₂-C₁₀-алкеніл, C₂-C₁₀-алкініл, C₃-C₈-циклоалкіл, феніл, нафтил; або

5- або 6-членний гетероцикліл, який містить від одного до чотирьох атомів азоту або від одного до трьох атомів азоту та один атом сірки або кисню; або

5- або 6-членний гетероарил, який містить від одного до чотирьох атомів азоту або від одного до трьох атомів азоту та один атом сірки або кисню;

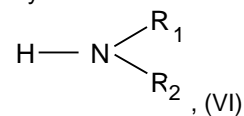
причому R¹ та R², якщо вони не позначають однаково водень, можуть бути незалежно один від одного частково або цілком галогеновані та/або можуть мати від одного до трьох залишків із групи R^a, причому

R^a включає ціано, нітро, гідрокси, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галогеналкокси, C₁-C₆-алкілтіо, C₁-C₆-алкіламіно, ді-C₁-C₆-алкіламіно, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₁₆-алкенілокси, C₂-C₆-алкініл, C₃-C₆-алкінілокси та необов'язково галогенований оксі-C₁-C₄-алкіленокси;

або

R¹ та R² разом з атомом азоту, який їх з'єднує,

де Hal означає галоген, та після цього піддають взаємодії з аміном формули VI



з одержанням 7-амінотриазолопіримідину формули I.

4. Засіб, придатний для боротьби з фітопатогенними грибами, який містить твердий або рідкий носій та 7-амінотриазолопіримідин загальної формули I за п. 1.

5. Спосіб боротьби з фітопатогенними грибами, який **відрізняється** тим, що гриби або уражені ними матеріали, рослини, ґрунт або посівне зерно, що підлягають захисту від них, обробляють ефективною кількістю 7-амінотриазолопіримідину загальної формули I за п. 1.

можуть утворювати 5- або 6-членний цикл, який містить від одного до чотирьох атомів азоту та від одного до трьох атомів азоту та один атом сірки або кисню та який може бути заміщений від одного до трьох залишками із групи R^a;

R³ позначає C₁-C₁₀-алкіл, C₂-C₁₀-алкеніл, C₂-C₁₀-алкініл, C₃-C₈-циклоалкіл, феніл-C₁-C₁₀-алкіл,

причому R³ може бути незаміщеним або частково або цілком галогенованим та/або може мати від одного до трьох залишків із групи R^a, або

позначає C₁-C₁₀ галогеналкіл, який може мати від одного до трьох залишків із групи R^a;

X позначає галоген, ціано, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкіл, феніл або заміщений залишком R^a феніл;

а також їхні солі.

Крім того, винахід відноситься до способу та до проміжного продукту для одержання сполук формули I, а також до засобу, який їх містить, та до застосування сполук формули I для боротьби з фітопатогенними грибами.

6-Арилтриазолопіримідини описуються в публікаціях WO 98/46608 та EP-A 550113. Заміщені ароматичними групами 6-бензилтриазолопіримідини з фармацевтичною дією відомі з публікацій US 5,231,094 та US 5,387,747. Європейська заявка EP-A 141317 описує 7-амінотриазолопіримідини, які у положенні 5 можуть мати алкільний залишок. 6-Циклоалкілтриазолопіримідини з різними залишками в положенні 5 приводяться в EP-A 613900.

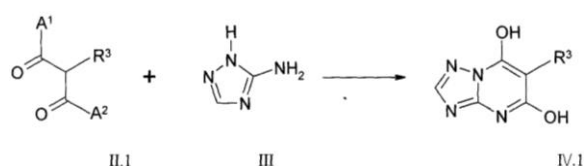
Описані у WO 98/46608, EP-A 550113, EP-A 141317 та EP-A 613900 сполуки придатні як засоби захисту рослин для боротьби з фітопатогенними грибами.

Однак, їх дія в багатьох випадках є незадовільною. Тому задачею винаходу є розробка сполук, які мають вдосконалену дію.

У відповідності з цим було розроблено 7-амінотріазолопіримідини формули I. Далі були розроблені проміжні продукти та спосіб одержання сполук формули I, а також застосування сполук I та засобів, які їх містять, для боротьби з фітопатогенними грибами.

Сполуки формули I відрізняються від сполук, приведених у вищезгаданих публікаціях, сполученням замісників X із залишком R³ на триазолопіримідиновому скелеті.

Сполуки формули I, де X позначає галоген, одержують, наприклад, виходячи з дикарбонільних сполук формули II.1, які циклізують 3-аміно-1,2,4-триазолом формули III з одержанням гідрокситриазолопіримідинів формули IV.1:



Реакція взаємодії здійснюється звичайно при температурі від 25°C до 210°C, переважно, від 120°C до 180°C, у присутності основи [див. EP-A-770615].

Як основа придатні, загалом, органічні основи, наприклад, такі третинні аміни, як триметиламін, триетиламін, триізопропілетиламін, трибутиламін та N-метилпіперидин, піридин. Особливо переважно застосовують триетиламін та трибутиламін.

Основи застосовують у загальному в каталітичній кількості, вони можуть застосовуватися також й у еквімолярній кількості, у надлишку або, у разі потреби, як розчинник.

Вихідні речовини можуть у загальному піддаватися взаємодії одна з одною у еквімолярних кількостях. Для виходу продукту може давати перевагу застосування сполуки формули II.1 у надлишку при перерахуванні на кількість сполуки формули III.

Необхідні для одержання сполук формули I вихідні речовини відомі з літературних джерел або можуть бути отримані згідно приведеними в літературних джерелах методам [див. Heterocycl. 1996, pp.1031-1047; Tetrahedron Lett. 1966, 24, 2661-2668] або можуть бути придбані комерційним шляхом.

Після цього гідрокситриазолопіримідини формули IV.1 піддають взаємодії з агентом галогенування з одержанням галогентриазолопіримідинів формули V.1:



Ця взаємодія протікає звичайно при темпера-

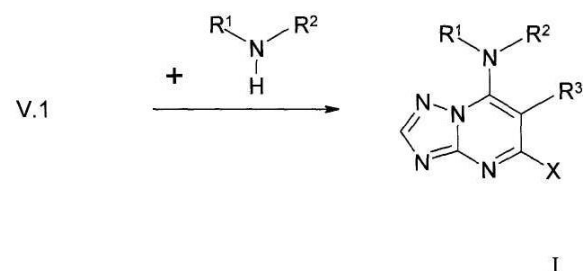
турі від 0°C до 150°C, переважно, від 80°C до 125°C, в інертному розчиннику або без додаткового розчинника [порівн. EP-A-770615].

Придатними агентами галогенування є переважно агенти бромовання або хлорування, наприклад, такі, як фосфороксибромід або фосфороксихлорид як речовина або в присутності розчинника.

Придатними розчинниками є аліфатичні вуглеводні, такі, як пентан, гексан, циклогексан або петролейний ефір, ароматичні вуглеводні, такі, як толуол, о-, м- та п-ксилол, особливо кращими є толуол, о-, м- та п-ксилол.

Можуть також застосовуватися й суміші приведених розчинників.

На закінчення галогентриазолопіримідини формули V.1 піддають взаємодії з аміном формули VI з одержанням 7-амінотріазолопіримідинов формули I, де X позначає галоген:



Цю взаємодію здійснюють при температурі від 0°C до 70°C, переважно, від 10°C до 35°C, в інертному органічному розчиннику в присутності основи [див. EP-A-550113].

Придатними розчинниками при цьому є ароматичні вуглеводні, такі, як толуол, о-, м- та п-ксилол, галогеновані вуглеводні, такі, як метиленхлорид, хлороформ та хлорбензол, простий ефір, такий, як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, трет.-бутилметиловий ефір, діоксан, анізол та тетрагідрофуран.

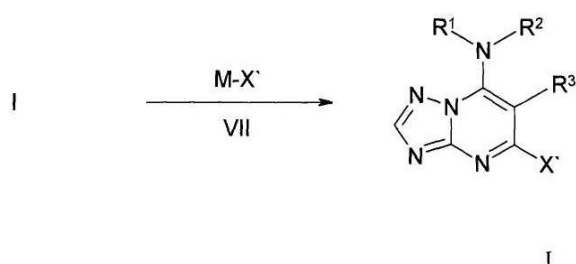
Як основа придатні такі ароматичні сполуки, як гідроксиди лужних та лужноземельних металів, такі, як гідроксид літію, гідроксид натрію, гідроксид калію та гідроксид кальцію, оксиди лужних та лужноземельних металів, такі, як оксид літію, оксид натрію, оксид кальцію та оксид магнію, гідриди лужних та лужноземельних металів, такі, як гідрид натрію, гідрид літію, гідрид калію та гідрид кальцію, амід лужних та лужноземельних металів, такі, як амід натрію та амід калію, карбонати лужних та лужноземельних металів, такі, як карбонат літію, карбонат калію та карбонат кальцію, а також гідрокарбонати лужних металів, такі, як гідрокарбонат натрію, металорганічні сполуки, зокрема, алкіли лужного металу, такі, як метиллітій, бутиллітій або феніллітій, галогеніди алкілмагнію, такі, як метилмагнійхлорид, а також алкоголяти лужних та лужноземельних металів, такі, як метаноліат натрію, етаноліат натрію, етаноліат калію, трет.-бутаноліат калію та диметоксимагній, крім того, органічні основи, наприклад, третинні аміни, такі, як триметиламін, триетиламін, триізопропілетиламін та N-метилпіперидин, піридин, заміщені піридини, такі, як колідин, лутидин та 4-диметиламінопіридин, а також біциклічні аміни. Особливо кращими є триети-

ламін, карбонат калію та карбонат натрію.

Основи застосовуються в загальному у каталітичній кількості, вони можуть однак застосовуватися й у еквімолярній кількості, у надлишку або, у разі потреби, як розчинник. Альтернативно до цього надлишок сполуки формули VI може служити як основа.

Вихідні речовини у загальному піддаються взаємодії одна з одною у еквімолярних кількостях. Для виходу може давати переваги застосування сполуки формули VI у надлишку при перерахуванні на кількість сполуки формули V.1.

Для того, щоб одержати 7-амінотріазолопіримідини формули I, у якій X позначає ціано або C₁-C₄-алкокси, 7-амінотріазолопіримідини формули I піддають взаємодії зі сполукою формули VII:



При цьому M позначає катіон амонію, тетраалкіламонію, катіон лужного або лужноземельного металу та X' позначає ціано або алкокси.

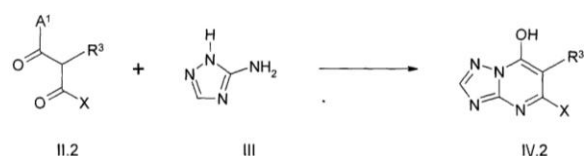
Таку взаємодію здійснюють звичайно при температурі від 0°C до 150°C, переважно, від 20°C до 75°C, в інертному органічному розчиннику [порівн. WO 99/41255].

Придатними розчинниками є прості ефіри, такі як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, трет.-бутилметилловий ефір, діоксан, анізол та тетрагідрофуран, такі спирти, як метанол, етанол, Н-пропанол, ізопропанол, Н-бутанол та трет.-бутанол, а також диметилсульфоксид, диметилформамід та диметилацетамід, особливо кращими є діетиловий ефір, тетрагідрофуран та диметилформамід.

Можуть застосовуватися також й суміші приведених розчинників.

Вихідні речовини в загальному піддаються взаємодії одна з одною у еквімолярних кількостях. Для виходу може давати переваги застосування сполуки формули VII у надлишку при перерахуванні на сполуку формули I.

7-Амінотріазолопіримідини формули I, де X позначає C₁-C₄-галоалкіл або, у разі потреби, заміщений залишком R^a феніл, можуть бути отримані виходячи з дикарбонільних сполук формули II.2, які циклізують 3-аміно-1,2,4-тріазолом формули III з одержанням 7-гідрокситриазолопіримідинів формули IV.2:



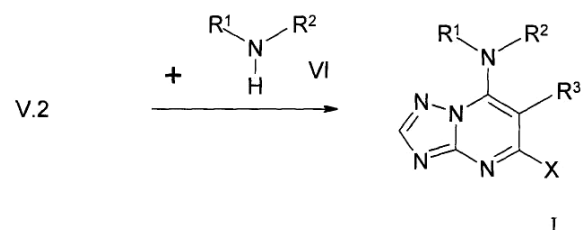
Реакція взаємодії протікає за тих самих умов, як й при вищенаведеній реакції сполуки формули 11.1 з одержанням сполуки формули IV.1.

Після цього 7-гідрокситриазолопіримідини формули IV.2 піддають взаємодії з агентом галогенування з одержанням 7-галогентриазолопіримідинів формули V.2:



Цю реакцію взаємодії здійснюють за тих самих умов, як при вищеописаній взаємодії сполуки формули IV.1 з одержанням сполуки формули V.1.

Після цього сполуку формули V.2 піддають взаємодії з аміном формули VI з одержанням сполуки формули I:

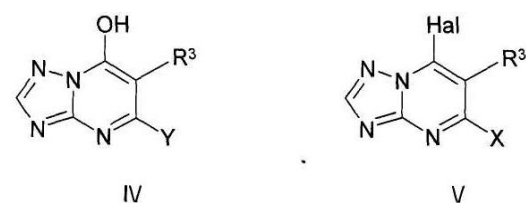


Цю реакцію взаємодії здійснюють за тих самих умов, як при вищеописаній взаємодії сполуки формули V.1 з одержанням сполуки формули I.

Реакційні суміші переробляють звичайним чином, наприклад, змішуванням з водою, поділом фаз і, у разі потреби, хроматографічним очищенням сирих продуктів. Проміжні та кінцеві продукти присутні у формі безбарвних або слабо коричневатих в'язких олій, які при помірно високих температурах звільняються від летучих часток та очищаються. Якщо проміжні та кінцеві продукти одержують у вигляді твердої речовини, очищення можна здійснювати перекристалізацією або дигеруванням.

Якщо окремі сполуки формули I не можна одержати вищенаведеним шляхом, вони можуть бути отримані деривацією інших сполук формули I.

7-Гідрокси- та 7-галогентриазолопіримідини формул IV та V,



де Y позначає гідроксильну групу або залишок із групи X відповідно до пункту 1 формули винаходу, причому Hal позначає галоген та R³, а X має приведені у п.1 значення, також є новими.

Особливо кращі проміжні продукти формул IV та V, у яких R³ позначає C₁-C₁₀-алкіл, зокрема,

CH_3 , $\text{CH}_2\text{-CH}_3$, $(\text{CH}_2)_3\text{-CH}_3$, $\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{CH}(\text{CH}_3)_3$, $\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$, $\text{C}(\text{CH}_3)_3$, $(\text{CH}_2)_7\text{-CH}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -алкеніл, зокрема, $\text{CH}_2\text{-CH=CH}_2$, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -циклоалкіл, зокрема, циклопропілметил, циклопентил, циклогексил, феніл- $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -алкіл, зокрема, $\text{CH}_2\text{-C}_6\text{H}_5$, $\text{CH}_2\text{-o-C}_6\text{H}_4$, $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -галоалкіл, зокрема, $\text{CH}_2\text{-CF}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CF}_3$, $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$. та X позначає галоген, зокрема, хлор, ціано, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкокси, зокрема, OCH_3 , $\text{C}_1\text{-C}_4$ -галоалкіл, зокрема, CF_3 , феніл або заміщений залишком R^a феніл, зокрема, феніл.

Приведені для вищестоящих формул значення є збірними поняттями, які у загальному представляють наступні замісники.

галоген позначає фтор, хлор, бром та йод;

алкіл позначає насичені, нерозгалужені або розгалужені вуглеводневі залишки з від 1 до 4, 6, 8 або 10 атомами вуглецю, наприклад, такий $\text{C}_1\text{-C}_6$ -алкіл, як метил, етил, пропіл, 1-метилетил, бутіл, 1-метилпропіл, 2-метилпропіл, 1,1-диметилетил, пентил, 1-метилбутіл, 2-метилбутіл, 3-метилбутіл, 2,2-диметилпропіл, 1-етилпропіл, гексил, 1,1-диметилпропіл, 1,2-диметил пропіл, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутіл, 1,2-диметилбутіл, 1,3-диметилбутіл, 2,2-диметилбутіл, 2,3-диметилбутіл, 3,3-диметилбутіл, 1-етилбутіл, 2-етилбутіл, 1,1,2-триметилпропіл, 1,2,2-триметилпропіл, 1-етил-1-метилпропіл та 1-етил-2-метилпропіл;

галогеналкіл позначає нерозгалужені або розгалужені алкільні групи з від 1 до 10 атомами вуглецю (як приведено вище), причому в цих групах частково, наприклад, від одного до трьох разів, або повністю атоми водню можуть бути замінені атомами галогену, як приведено вище, наприклад, такий $\text{C}_1\text{-C}_2$ -галогеналкіл, як хлорметил, бромметил, дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорфторметил, дихлорфторметил, хлордифторметил, 1-хлоретил, 1-бромметил, 1-фторетил, 2-фторетил, 2,2-дифторетил, 2,2,2-трифторетил, 2-хлор-2-фторетил, 2-хлор-2,2-дифторетил, 2,2-дихлор-2-фторетил, 2,2,2-трихлоретил та пентафторетил;

алкокси позначає нерозгалужені або розгалужені алкільні групи з від 1 до 6 атомами вуглецю (як приведено вище), які зв'язані зі скелетом через атом кисню (-O-);

галогеналкокси позначає нерозгалужені або розгалужені галогеналкільні групи з від 1 до 6 атомами вуглецю (як приведено вище), які зв'язані зі скелетом через атом кисню (-O-);

алкільтію позначає нерозгалужені або розгалужені алкільні групи з від 1 до 6 атомами вуглецю (як приведено вище), які зв'язані зі скелетом через атом сірки (-S-);

алкіламіно позначає нерозгалужені або розгалужені алкільні групи з від 1 до 6 атомами вуглецю (як приведено вище), які зв'язані зі скелетом через аміногрупу (-NH-);

діалкіламіно позначає два незалежні один від одного розгалужені або нерозгалужені алкільні групи кожна з від 1 до 6 атомами вуглецю (як приведено вище), які зв'язані зі скелетом через атом азоту;

алкеніл позначає ненасичені, нерозгалужені

або розгалужені вуглеводневі залишки з від 2 до 6 або 10 атомами вуглецю та одним подвійним зв'язком у будь-якому положенні, наприклад, такий $\text{C}_2\text{-C}_6$ -алкеніл, як етеніл, 1-пропеніл, 2-пропеніл, 1-метилетеніл, 1-бутеніл, 2-бутеніл, 3-бутеніл, 1-метил-1-пропеніл, 2-метил-1-пропеніл, 1-метил-2-пропеніл, 2-метил-2-пропеніл, 1-пентеніл, 2-пентеніл, 3-пентеніл, 4-пентеніл, 1-метил-1-бутеніл, 2-метил-1-бутеніл, 3-метил-1-бутеніл, 1-метил-2-бутеніл, 2-метил-2-бутеніл, 3-метил-2-бутеніл, 1-метил-3-бутеніл, 2-метил-3-бутеніл, 3-метил-3-бутеніл, 1,1-диметил-2-пропеніл, 1,2-диметил-1-пропеніл, 1,2-диметил-2-пропеніл, 1-етил-1-пропеніл, 1-етил-2-пропеніл, 1-гексеніл, 2-гексеніл, 3-гексеніл, 4-гексеніл, 5-гексеніл, 1-метил-1-пентеніл, 2-метил-1-пентеніл, 3-метил-1-пентеніл, 4-метил-1-пентеніл, 1-метил-2-пентеніл, 2-метил-2-пентеніл, 3-метил-2-пентеніл, 4-метил-2-пентеніл, 1-метил-3-пентеніл, 2-метил-3-пентеніл, 3-метил-3-пентеніл, 4-метил-3-пентеніл, 1-метил-4-пентеніл, 2-метил-4-пентеніл, 3-метил-4-пентеніл, 4-метил-4-пентеніл, 1,1-диметил-2-бутеніл, 1,1-диметил-3-бутеніл, 1,2-диметил-1-бутеніл, 1,2-диметил-2-бутеніл, 1,2-диметил-3-бутеніл, 1,3-диметил-1-бутеніл, 1,3-диметил-2-бутеніл, 1,3-диметил-3-бутеніл, 2,2-диметил-3-бутеніл, 2,3-диметил-1-бутеніл, 2,3-диметил-2-бутеніл, 2,3-диметил-3-бутеніл, 3,3-диметил-1-бутеніл, 3,3-диметил-2-бутеніл, 1-етил-1-бутеніл, 1-етил-2-бутеніл, 1-етил-3-бутеніл, 2-етил-1-бутеніл, 2-етил-2-бутеніл, 2-етил-3-бутеніл, 1,1,2-триметил-2-пропеніл, 1-етил-1-метил-2-пропеніл, 1-етил-2-метил-1-пропеніл та 1-етил-2-метил-2-пропеніл;

алкєнілокси позначає ненасичені, нерозгалужені або розгалужені вуглеводневі залишки з від 3 до 6 атомами вуглецю та подвійним зв'язком у будь-якому несуміжному з гетероатомом положенні (як описано вище), які зв'язані зі скелетом через атом кисню (-O-);

алкініл позначає нерозгалужені або розгалужені вуглеводневі групи з від 2 до 6 або 10 атомами вуглецю та потрійним зв'язком у будь-якому положенні, наприклад, такий $\text{C}_3\text{-C}_6$ -алкініл, як етиніл, 1-пропініл, 2-пропініл, 1-бутиніл, 2-бутиніл, 3-бутиніл, 1-метил-2-пропініл, 1-пентиніл, 2-пентиніл, 3-пентиніл, 4-пентиніл, 1-метил-2-бутиніл, 1-метил-3-бутиніл, 2-метил-3-бутиніл, 3-метил-1-бутиніл, 1,1-диметил-2-пропініл, 1-етил-2-пропініл, 1-гексиніл, 2-гексиніл, 3-гексиніл, 4-гексиніл, 5-гексиніл, 1-метил-2-пентиніл, 1-метил-3-пентиніл, 1-метил-4-пентиніл, 2-метил-3-пентиніл, 2-метил-4-пентиніл, 3-метил-1-пентиніл, 3-метил-4-пентиніл, 4-метил-1-пентиніл, 4-метил-2-пентиніл, 1,1-диметил-2-бутиніл, 1,1-диметил-3-бутиніл, 1,2-диметил-3-бутиніл, 2,2-диметил-3-бутиніл, 3,3-диметил-1-бутиніл, 1-етил-2-бутиніл, 1-етил-3-бутиніл, 2-етил-3-бутиніл та 1-етил-1-метил-2-пропініл;

алкінілоокси позначає ненасичені, нерозгалужені або розгалужені вуглеводневі залишки з від 3 до 6 атомами вуглецю та потрійним зв'язком у будь-якому положенні, яке не є несуміжним гетероатому (як приведено вище), які зв'язані зі скелетом через атом кисню (-O-);

циклоалкіл позначає моноциклічні, насичені

вуглеводневі групи з від 3 до 5, 6, або 8 вуглецевими членами кільця, наприклад, C_3 - C_8 -циклоалкіл, такий, як циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептил та циклооктил;

5- або 6-членні гетероцикли (гетероциклі), які містять поряд з вуглеводневими кільцевими членами від одного до чотирьох атомів азоту та/або один атом кисню або сірки або один атом кисню та/або сірки, наприклад, 2-тетрагідрофураніл, 3-тетрагідрофураніл, 2-тетрагідротієніл, 3-тетрагідротієніл, 2-піролідініл, 3-піролідініл, 3-ізоксазолідініл, 4-ізоксазолідініл, 5-ізоксазолідініл, 3-ізотіазолідініл, 4-ізотіазолідініл, 5-ізотіазолідініл, 3-піразолідініл, 4-піразолідініл, 5-піразолідініл, 2-оксазолідініл, 4-оксазолідініл, 5-оксазолідініл, 2-тіазолідініл, 4-тіазолідініл, 5-тіазолідініл, 2-імідазолідініл, 4-імідазолідініл, 1,2,4-оксадіазолідін-3-іл, 1,2,4-оксадіазолідін-5-іл, 1,2,4-тіадіазолідін-3-іл, 1,2,4-тіадіазолідін-5-іл, 1,2,4-тіазолідін-3-іл, 1,3,4-оксазолідін-2-іл, 1,3,4-тріадіазолідін-2-іл, 1,3,4-тріазолідін-2-іл, 2,3-дигідрофур-2-іл, 2,3-дигідрофур-3-іл, 2,4-дигідрофур-2-іл, 2,4-дигідрофур-3-іл, 2,3-дигідротієн-2-іл, 2,3-дигідротієн-3-іл, 2,4-дигідротієн-2-іл, 2,4-дигідротієн-3-іл, 2-піролін-2-іл, 2-піролін-3-іл, 3-піролін-2-іл, 3-піролін-3-іл, 2-ізоксалін-3-іл, 3-ізоксалін-3-іл, 4-ізоксалін-3-іл, 2-ізоксалін-4-іл, 3-ізоксалін-4-іл, 4-ізоксалін-4-іл, 2-ізоксалін-5-іл, 3-ізоксалін-5-іл, 4-ізоксалін-5-іл, 2-ізотіазолін-3-іл, 3-ізотіазолін-3-іл, 4-ізотіазолін-4-іл, 2-ізотіазолін-4-іл, 3-ізотіазолін-4-іл, 4-ізотіазолін-4-іл, 2-ізотіазолін-5-іл, 3-ізотіазолін-5-іл, 4-ізотіазолін-5-іл, 2,3-дигідропіразол-1-іл, 2,3-дигідропіразол-2-іл, 2,3-дигідропіразол-3-іл, 2,3-дигідропіразол-4-іл, 2,3-дигідропіразол-5-іл, 3,4-дигідропіразол-1-іл, 3,4-дигідропіразол-3-іл, 3,4-дигідропіразол-4-іл, 3,4-дигідропіразол-5-іл, 4,5-дигідропіразол-1-іл, 4,5-дигідропіразол-3-іл, 4,5-дигідропіразол-4-іл, 4,5-дигідропіразол-5-іл, 2,3-дигідрооксазол-2-іл, 2,3-дигідрооксазол-3-іл, 2,3-дигідрооксазол-4-іл, 2,3-дигідрооксазол-5-іл, 3,4-дигідрооксазол-2-іл, 3,4-дигідрооксазол-3-іл, 3,4-дигідрооксазол-4-іл, 3,4-дигідрооксазол-5-іл, 3,4-дигідрооксазол-2-іл, 3,4-дигідрооксазол-3-іл, 3,4-дигідрооксазол-4-іл, 2-піперидиніл, 3-піперидиніл, 4-піперидиніл, 1,3-діоксан-5-іл, 2-тетрагідропіраніл, 4-тетрагідропіраніл, 2-тетрагідротієніл, 3-гексагідропіридазиніл, 4-гексагідропіридазиніл, 2-гексагідропіримідиніл, 4-гексагідропіримідиніл, 5-гексагідропіримідиніл, 2-піперазиніл, 1,3,5-гексагідротриазин-2-іл та 1,2,4-гексагідротриазин-3-іл;

5-членний гетероарил, який містить від одного до чотирьох атомів азоту або від одного до трьох атомів азоту або один атом сірки або кисню; позначає 5-членний гетероарильний цикл, який поряд з атомами вуглецю може містити від одного до чотирьох атомів азоту або від одного до трьох атомів азоту та один атом сірки або кисню як кільцеві члени, наприклад, 2-фурил, 3-фурил, 2-тієніл, 3-тієніл, 2-піроліл, 3-піроліл, 3-ізоксазоліл, 4-ізоксазоліл, 5-ізоксазоліл, 3-ізотіазоліл, 4-ізотіазоліл, 5-ізотіазоліл, 3-піразоліл, 4-піразоліл, 5-піразоліл, 2-оксазоліл, 4-оксазоліл, 5-оксазоліл,

2-тіазоліл, 4-тіазоліл, 5-тіазоліл, 2-імідазоліл, 4-імідазоліл, 1,2,4-оксадіазол-3-іл, 1,2,4-оксадіазол-5-іл, 1,2,4-тіадіазол-3-іл, 1,2,4-тіадіазол-5-іл, 1,2,4-тріазол-3-іл, 1,3,4-оксадіазол-2-іл, 1,3,4-тіадіазол-2-іл та 1,3,4-тріазол-2-іл;

6-членний гетероарил, який містить від одного до трьох, відповідно, від одного до чотирьох атомів азоту: 6-членні гетероарильні групи, які поряд з атомами вуглецю можуть містити від одного до трьох, відповідно, від одного до чотирьох атомів азоту як кільцеві члени, наприклад, 2-піридиніл, 3-піридиніл, 4-піридиніл, 3-піридазиніл, 4-піридазиніл, 2-піримідил, 4-піримідил, 5-піримідил, 2-піразиніл, 1,3,5-тріазин-2-іл та 1,2,4-тріазин-3-іл,

оксикалієноокси позначає двовалентні нерозгалужені ланцюги з від 1 до 3 CH_2 -груп, причому обидві валентності зв'язані зі скелетом через атом кисню, наприклад, OCH_2O , OCH_2CH_2O та $OCH_2CH_2CH_2O$;

Сполуки формули I можуть існувати у формі придатних у сільському господарстві солей, причому, як правило, вид солі не має значення. У загальному придатні солі таких катіонів або солі приєднання таких кислот, катіони, відповідно, аніони яких не чинять негативний вплив на фунгіцидну дію сполук формули I.

Як катіони придатні зокрема, іони лужних металів, переважно, літію, натрію та калію, лужноземельних металів, переважно, кальцію та магнію, та перехідних металів, переважно, марганцю, міді, цинку та заліза, а також, амоній, причому, за бажанням, від одного до чотирьох атомів водню можуть бути заміщені C_1 - C_4 -алкілом, гідрокси- C_1 - C_4 -алкілом, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілом, гідрокси- 1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілом, фенілом або бензилом, переважно, амоній, диметиламоній, діізопропіламоній, тетраметиламоній, тетрабутиламоній, 2-(2-гідроксіет-1-окси)ет-1-іламоній, ди(2-гідроксіет-1-іл)амоній, триметилбензиламоній, крім того, іони фосфонію, іони сульфонію, переважно три(C_1 - C_4 -алкіл)сульфоній та іони сульфоксонію, переважно, три(C_1 - C_4 -алкіл)сульфоксоній.

Аніонами придатних солей кислот приєднання є у першу чергу хлорид, бромід, фторид, гідросульфат, сульфат, дигідросульфат, гідрофосфат, нітрат, гідрокарбонат, гексафторсилікат, гексафторфосфат, бензоат, а також аніони C_1 - C_4 -алканової кислоти, переважно, формиат, ацетат, пропіонат та бутират.

З урахуванням застосування 7-амінотріазолопіримідинів формули I наступні значення замісників, а саме, окремо або в комбінації, є особливо кращими:

Сполуки формули I, у яких R^1 , R^2 позначають водень, C_1 - C_{10} -алкіл або C_1 - C_{10} -галогеналкіл, зокрема, водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_4 -галогеналкіл, особливо переважно водень, 1-метилпропіл, ізопропіл або 1,1,1-трифтор-2-пропіл, або

R^1 та R^2 разом з атомом азоту, який їх зв'язує, утворюють 5-або 6-членний цикл, який може містити один атом кисню та/або може мати один C_1 - C_4 -алкільний залишок, наприклад, пірол ідин-1-іл, пірол-1-іл, піразол-1-іл, імідазол-1-іл, піперидин-1-іл, морфолін-4-іл, причому приведені залишки можуть бути заміщені від одного до трьох залишками

R^a , зокрема, C_1 - C_4 -алкіл, такий, як метил або етил.

Поряд з цим особливо кращими є сполуки формули I, у яких R^1 позначає водень, C_1 - C_6 -алкіл та C_1 - C_4 -галогеналкіл та R^2 позначає водень.

Особливо кращими є також сполуки формули I, у яких R^1 та R^2 позначають водень та R^3 позначає C_3 - C_8 -циклоалкіл, переважно, циклопропіл, циклопентил або циклогексил.

Крім того, особливо кращими є сполуки формули I, у яких R^3 позначає C_1 - C_8 -алкіл, зокрема, ізопропіл або *n*-октил, C_3 - C_6 -циклоалкіл, особливо переважно, циклопропіл, циклопентил або циклогексил, або CH_2 - C_6H_5 .

Зокрема, кращими є сполуки формули I, у яких R^3 позначає C_3 - C_8 -циклоалкіл, зокрема, C_3 - C_6 -циклоалкіл, особливо переважно циклопропіл, циклопропілметил, циклопентил або циклогексил, та X позначає ціано, C_1 - C_4 -алкокси, наприклад, $OSCH_3$, C_1 - C_4 -галогеналкіл, наприклад, CF_3 або необов'язково заміщений залишком R^a фенілалкіл, наприклад, CH_2 - C_6H_5 або CH_2 -o- Cl - C_6H_4 .

Крім того, особливо кращими є сполуки формули I, у якій R^3 позначає C_3 - C_8 -циклоалкіл, зокрема, C_3 - C_6 -циклоалкіл, особливо переважно циклопропіл, циклопентил або циклогексил, та X позначає галоген, зокрема, хлор.

В однаковому ступені кращими є сполуки формули I, у яких X позначає галоген, такий, як хлор або бром, зокрема, хлор.

З урахуванням їх застосування особливо кращі сполуки формули I, зведені у нижченаведеній таблиці. Приведені в таблицях для одного замісника групи являють собою, крім того, незалежно від комбінації, у якій вони приводяться, особливо краще виконання відповідного замісника.

Таблиця 1

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає CH_3 , X позначає Cl та комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 2

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає CH_2 - CH_3 , X позначає Cl та комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 3

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає $(CH_2)_3$ - CH_3 та X позначає Cl та комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 4

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає CH_2 - $CH(CH_3)_2$, X позначає Cl та комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 5

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає $C(H(CH_3)-CH_2-CH_2-CH_3)$, X позначає Cl та комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 6

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає $C(CH_3)_3$, X позначає Cl та комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 7

Сполуки формули 1, у якій R^3 позначає $(CH_2)_7$ - CH_3 , X позначає Cl та комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 8

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає $CH(CH_3)_2$, X позначає Cl та комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 9

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає циклопентил, X позначає Cl та комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 10

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає циклогексил, X позначає Cl та комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 11

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає CH_2 - C_6H_5 , X позначає Cl та комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 12

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає CH_2 -o- Cl - C_6H_4 , X позначає Cl і комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 13

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає $(CH_2)_2$ - CH_3 , X позначає Cl та комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 14

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає CH_2 - $CH=CH_2$, X позначає Cl та комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 15

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає циклопропілметил, X позначає Cl та комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 16

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає CH_2 - CH_2 -CN, X позначає Cl та комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 17

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає CH_2 - CF_3 , X позначає Cl і комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 18

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає $CH(CH_3)$ - CF_3 , X позначає Cl та комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 19

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає $CH(CF_3)_2$, X позначає Cl і комбінація залишків R^1 та R^2 відповідає сполуці відповідно до одного рядка таблиці A.

Таблиця 20

Сполуки формули I, у якій R^3 позначає CH_3 , X

Таблиця А

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

A-59	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-60	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-61	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-62	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-63	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-64	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-65	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-66	циклопентил	H
A-67	циклопентил	CH ₃
A-68	циклопентил	CH ₂ CH ₃
A-69	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	

Особливо кращі форми проміжних продуктів, що стосується замісників, відповідають замісникам із залишками R¹, R², R^a, R³ та X формули I.

Сполуки I придатні як фунгіциди. Вони відрізняються прекрасною активністю проти широкого спектра фітопатогенних грибів, зокрема, із класу аскоміцетів, дейтероміцетів, фікомицетів та базидіоміцетів.

Вони є частково систематично активними та можуть застосовуватися при захисті рослин у якості ґрунтових та листяних фунгіцидів.

Вони мають особливе значення при боротьбі з рядом фітопатогенних грибів на різних культурних рослинах, таких, як пшениця, жито, ячмінь, овес, рис, кукурудза, злаки, банани, бавовник, соєві, кава, цукровий очерет, виноград, плодові та декоративні рослини, та на овочевих культурах, таких, як огірки, бобові, томати, картопля та гарбузові, а також на насінні цих рослин.

Особливо вони придатні для боротьби проти наступних хвороб рослин:

- види *Alternaria*, види *Podosphaera*, види *Sclerotinia*, *Physalospora* canker на овочевих та фруктових,

- *Botrytis cinerea* (сіра гнилизна) на полуниці, овочевих, декоративних рослинах та виноградній лозі,

- *Corynespora cassiicola* на огірках,

- види *Colletotrichum* на овочевих та фруктових,

- *Diplocarpon rosae* на трояндах,

- *Elsinoe fawcetti* та *Diaporthe citri* на цитрусових плодах,

- види *Sphaerotheca* на гарбузових, полуниці та трояндах,

- види *Cercospora* на земляних горіхах, цукровому буряку та баклажанах, *Erysiphe cichoracearum* на гарбузових,

- *Leveillula taurica* на перці, помідорах та баклажанах,

- види *Mycosphaerella* на яблуневих та японських абрикосах,

- *Phyllactinia kakeicola*, *Gloesporium kaki*, на японських абрикосах,

- *Gymnosporangium yamadai*, *Leptothyrium pomi*, *Podosphaera leucotricha* і *Gloeodes pomigena* на яблуневих,

- *Cladosporium carpophilum* на грушевих та японських абрикосах,

- види *Phomopsis* на грушевих,

- види *Phytophthora* на цитрусових, картоплі, цибульних, зокрема, *Phytophthora infestans* на картоплі та помідорах,

- *Blumeria graminis* (справжня борошниста роса) на зернових культурах,
- види *Fusarium* та *Verticillium* на різних рослинах,
- *Glomerella cingulata* на чаї,
- види *Drechslera* та *Bipolaris* на зернових культурах та рисі,
- види *Mycosphaerella* на бананових та земляному горісі,
- *Plasmopara viticola* на виноградній лозі,
- види *Peronospora* на цибульних, шпинаті та хризантемах,
- *Phaeoisariopsis vitis* та *Sphaceloma ampelina* на грейпфруті,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* на пшениці та ячмені,
- види *Pseudoperonospora* на хмелі та огіркових,
- види *Puccinia* та *Typhula* на зернових та деревині,
- *Pyricularia oryzae* на рисі,
- види *Rhizoctonia* на бавовнику, рисі та деревині,
- *Stagonospora nodorum* та *Septoria tritici* на пшениці,
- *Uncinula necator* на виноградній лозі,
- види *Ustilago* на зернових та цукровому очереті, а також
- види *Venturia* (парша) на яблуневих та грушевих.

Крім того, сполуки I придатні для боротьби з такими фітопатогенними грибами, як *Raecilomyces variotii* при захисті матеріалів (наприклад, деревини, папера, у дисперсіях для покриття, волокон, відповідно, тканин) та при захисті складованих запасів.

Сполуки I застосовуються таким чином, що гриби або рослини, матеріали або ґрунт, які підлягають захисту від ураження ними, обробляють фунгіцидною активною кількістю діючої речовини. Застосування може здійснюватися як перед, так й після ураження грибами матеріалів, рослин або насіння.

Фунгіцидні засоби містять у загальному між 0,1 та 95, переважно, між 0,5 та 90 мас.% діючої речовини.

Норми витрати складають при застосуванні для захисту рослин у залежності від бажаного ефекту між 0,01 та 2,0 кг діючої речовини на гектар.

При обробці посівного зерна в загальному потрібно кількості діючої речовини від 0,001 до 0,1 г, переважно від 0,01 до 0,05 г на кг посівного матеріалу.

При застосуванні для захисту матеріалів, відповідно, складованих запасів норма витрати орієнтується на область застосування та на бажаний ефект. Звичайні норми витрати при захисті матеріалів складають, наприклад, від 0,001 г до 2 кг, переважно, від 0,005 г до 1 кг діючої речовини на кубометр матеріалу, який піддають обробці.

Сполуки I можуть бути переведені в звичайні препаративні форми, наприклад, розчини, емульсії, суспензії, тонкі порошки, порошки, паста та грануляти. Препаративна форма залежить від мети застосування, вона повинна в будь-якому випадку забезпечувати тонкий та рівномірний розподіл

сполуки відповідно до винаходу.

Препаративні форми одержують відомим чином, наприклад, шляхом розведення діючої речовини в розчинниках та/або наповнювачах, за бажанням із застосуванням емульгаторів або диспергаторів, причому при застосуванні як розріджувач води також й інші органічні розчинники можуть застосовуватися як допоміжні агенти. У якості допоміжних агентів придатні в основному: розчинники, такі, як ароматичні (наприклад, ксилол), хлоровані ароматичні сполуки (наприклад, хлорбензоли), парафіни (наприклад, фракції нафти), спирти (наприклад, метанол, бутанол), кетони (наприклад, циклогексанон), аміни (наприклад, етаноламін, диметилформамід) та вода; наповнювачі, такі, як природні подрібнені породи (наприклад, каолін, глинозем, тальк, крейда) та штучні подрібнені породи (наприклад, високодисперсна кремнієва кислота, солі кремнієвої кислоти); емульгатори, такі, як неіоногенні та аніонні емульгатори (наприклад, поліоксіетиленовий ефір спирту жирного ряду, алкілсульфонати та арилсульфонати) та диспергатори, такі, як лігнінсульфітний відпрацьований щелок та метилцелюлоза.

Як поверхнево-активні речовини застосовуються солі лужних, лужноземельних металів та амонієві солі лігнінсульфофосфокислоти, нафталінсульфофосфокислоти, фенолсульфофосфокислоти, дибутілнафталінсульфофосфокислоти, алкіларилсульфонати, алкілсульфати, алкілсульфонати, сульфати спиртів жирного ряду, кислоти жирного ряду, а також їхньої солі лужних та лужноземельних металів, солі сульфатованого гліколевого ефіру жирного ряду, продукти конденсації сульфонованого нафталіну та похідних нафталіну з формальдегідом, продукти конденсації нафталіну, відповідно, нафталінсульфофосфокислот з фенолом та формальдегідом, поліоксіетилен-октилфенольний ефір, етоксильований ізооктилфенол, октилфенол, нонілфенол, алкілфенолполігліколевий ефір, трибутилфенілполігліколевий ефір, алкіларилполіефірні спирти, ізотридециловий спирт, продукти конденсації етиленоксиду жирних спиртів, етоксильована касторова олія, поліоксіетиленалкіловий ефір, етоксильований поліоксипропілен, ацеталь полігліколевого ефіру лаурилового спирту жирного ряду, складний ефір сорбіту, лігнінісульфітні відпрацьовані луки та метилцелюлоза.

Для одержання розчинів, які призначені для безпосереднього розбризкування, емульсій, паст, або масляних дисперсій застосовуються фракції мінеральних олій із середньою та високою точками кипіння; такі, як гас або дизельне паливо (масло), дьогтьові олії рослинного або тваринного походження, аліфатичні, циклічні та ароматичні вуглеводні, наприклад, бензол, толуол, ксилол, парафін, тетрагідронафталін, алкільовані нафталіни або їхні похідні, метанол, етанол, пропанол, бутанол, хлороформ, тетрахлорвуглець, циклогексанол, циклогексанон, хлорбензол, ізоформ, сильно полярні розчинники, наприклад, диметилформамід, діетилсульфоксид, N-метилпіролідон, вода.

Порошкові препарати, препарати для обпилювання та обпудрювання можуть бути виготовлені шляхом змішування або спільного розмелювання діючих речовин із твердим наповнювачем.

Гранулят, наприклад, оболонковий, імпрегнований або гомогенний гранулят може бути отриманий шляхом зв'язування діючої речовини з твердими наповнювачами. Твердими наповнювачами можуть бути, наприклад, мінеральні землі, такі, як силікагель, кремнієві кислоти, силікати, тальк, каолін, атаклау, вапняк, вапно, крейда, болюс, лес, глина, доломіт, діатомова земля, сульфат кальцію та магнею, окис магнею, подрібнена пластмаса, добрива, такі, як сульфат амонію, фосфат амонію, нітрат амонію, сечовини та рослинні продукти, такі, як зернове борошно, борошно деревної кори, деревне борошно та борошно горіхової шкарлупи, порошок целюлози та інші тверді наповнювачі.

Препаративні форми містять у загальному між 0,01 та 95мас.%, переважно між 0,1 та 90мас.% діючої речовини. Діючі речовини мають при цьому чистоту від 90% до 100%, переважно, від 95% до 100% (за спектром ЯМР).

Приклади препаративних форм:

I. 5ваг.часток сполуки відповідно до винаходу ретельно перемішують з 95ваг.частками тонкого каоліну. У такий спосіб одержують засіб для обпилювання, який містить 5мас.% діючої речовини.

II. 30ваг.часток сполуки відповідно до винаходу ретельно перемішують з 92ваг.частками порошкового силікагелю та 8ваг.частками парафінової олії, яку напριскують на поверхню цього силікагелю. У такий спосіб одержують препаративну форму діючої речовини з гарними адгезивними властивостями (вміст діючої речовини 23мас.%).

III. 10ваг.часток сполуки відповідно до винаходу розчиняють у суміші, яка складається з 90ваг.часток ксилолу, 6ваг.часток продукту приєднання від 8 до 10молів етиленоксиду до 1моля N-моноетаноламідів олеїнової кислоти, 2ваг.часток кальцієвої солі додецилбензолсульфоїкслоти та 2ваг.часток продукту приєднання 40молів етиленоксиду до 1моля касторової олії (вміст діючої речовини 9мас.%).

IV. 20ваг.часток сполуки відповідно до винаходу розчиняють у суміші, яка складається з 60ваг.часток циклогексанону, 30ваг.часток ізобутанолу, 5ваг.часток продукту приєднання 7молів етиленоксиду до 1моля ізооктилфенолу та 5ваг.часток продукту приєднання 40молів етиленоксиду до 1моля касторової олії (вміст діючої речовини 16мас.%).

V. 80ваг.часток сполуки відповідно до винаходу добре перемішують з 3ваг.частками натрієвої солі діізобутилнафталін-альфа-сульфоїкслоти, 10ваг.частками натрієвої солі лігнінсульфоїкслоти із сульфїтного відпрацьованого щелока та 7ваг.частками порошкового силікагелю та перемелюють у молотковому млині (вміст діючої речовини 80мас.%).

VI. Перемішують 90ваг.часток сполуки відповідно до винаходу з 10ваг.частками N-метил-α-піролідону та одержують розчин, який придатний для застосування у формі дрібних крапель (вміст діючої речовини 90мас.%).

VII. 20 ваг. часток сполуки відповідно до винаходу розчиняють у суміші, яка складається з 40ваг.часток циклогексанону, 30ваг.часток ізобутанолу, 20ваг.часток продукту приєднання 7молів етиленоксиду до 1моля ізооктилфенолу та

10ваг.часток продукту приєднання 40молів етиленоксиду до 1моля касторової олії. Шляхом концентрації та тонкого розподілу розчину у 10000ваг.частках води одержують водну дисперсію, яка містить 0,02мас.% діючої речовини.

VIII. 20ваг.часток сполуки відповідно до винаходу добре перемішують з 3ваг.частками натрієвої солі діізобутилнафталін-α-сульфоїкслоти, 17ваг.частками натрієвої солі лігнінсульфоїкслоти із сульфїтного відпрацьованого щелока та 60ваг.частками порошкового силікагелю та перемелюють у молотковому млині. Шляхом тонкого розподілу суміші в 20000ваг.частках води одержують розчин для обприскування, який містить 0,1мас.% діючої речовини.

Діючі речовини можуть застосовуватися як такі, у їхній препаративній формі або ж у приготуванні з них формі застосування, наприклад, у формі розчинів, які підлягають безпосередньому розпиленню, порошоків, суспензій або дисперсій, емульсій, масляних дисперсій, паст, препаратів для обпилювання, препаратів для обпудрювання, гранулятів шляхом обприскування, мілкокраплинного обприскування, обпилювання, обпудрювання або поливу. Форми, які використовують, залежать від мети застосування, але у всіх випадках повинний бути забезпечений максимально тонкий розподіл діючих речовин відповідно до винаходу.

Водні препаративні форми можуть бути приготувані з концентратів емульсій, паст або порошоків, які змочуються, (порошки для розбрикування, дисперсії) шляхом додавання води. Для виготовлення емульсій, паст або масляних дисперсій речовини як такі, або ж розчинені в олії, можуть гомогенізуватися у воді за допомогою змочувальних агентів, активаторів адгезії, диспергаторів або емульгаторів. Можуть також приготування концентрати, які складаються з діючої речовини, змочувального агента, активатора адгезії, диспергатора або емульгатора і, можливо, з розчинника та олії, які можна розбавляти водою.

Концентрація діючої речовини в готових до застосування препаратах може варіювати у широких межах. У загальному вона складає від 0,0001 до 10%, переважно, від 0,01 до 1%.

Діючі речовини можуть застосовуватися з успіхом при особливо низьких нормах витрати (ULV), причому є можливість використовувати препарати з більш, ніж 95мас.% діючої речовини або навіть застосовувати діючу речовину без добавок.

До діючих речовин можуть додаватися олії різного типу, гербіциди, фунгіциди, інші засоби боротьби зі шкідниками, бактерициди, у випадку необхідності, також та безпосередньо перед застосуванням (суміші в баці). Ці засоби можуть домішуватися до сполук відповідно до винаходу у ваговому співвідношенні від 1:10 до 10:1.

Сполуки відповідно до винаходу у формі застосування як фунгіциди можуть застосовуватися разом з іншими діючими речовинами, наприклад, гербіцидами, інсектицидами, регуляторами росту, фунгіцидами або ж добривами. При змішуванні сполук I, відповідно, фунгіцидних засобів, які містять їх, з іншими фунгіцидами в багатьох випадках забезпечується збільшення спектра фунгіцидної дії.

Нижчеподаний перелік фунгіцидів, які можна застосовувати разом зі сполуками відповідно до винаходу, пояснює можливості їхнього комбінування, однак не обмежує їх. До таких фунгіцидів відносяться наступні:

- сірка, дитіокарбамати та їхні похідні, такі, як феридиметилдитіокарбамат, цинкдиметилдитіокарбамат, цинкетиленбісдитіокарбамат, марганецьетиленбісдитіокарбамат, марганецьцинкетилендіамінбісдитіокарбамат, тетраметилтіурамідсульфіди, аміачний комплекс цинк(N,N-етиленбісдитіокарбамату), аміачний комплекс цинк-(N,N'-пропіленбіс-дитіокарбамату), N,N'-поліпропіленбіс(тіокарбомойл)дисульфід;

- нітропохідні, такі, як динітро-(1-метилгептил)-фенілкротонат, 2-втор.-бутил-4,6-динітрофеніл-3,3-диметилакрилат, 2-втор.-бутил-4,6-динітрофеніл-ізопропілкарбонат, діізопропіловий ефір 5-нітроізофталевої кислоти;

- гетероциклічні сполуки, такі, як 2-гептадецил-2-імідазоліацетат, 2-хлор-N-(4'-хлорбіфеніл-2-іл)-нікотинамід, 2,4-дихлор-6-(о-хлораніліно)-s-триазин, O,O-діетилфталімідофосфонотіоат, 6-аміно-1-[біс-(диметиламіно)-фосфініл]-3-феніл-1,2,4-триазол, 2,3-диціано-1,4-дитіоантрахінон, 2-тіо-1,3-дитіоло[4,5-b]хіноксалін, метиловий ефір 1-(бутилкарбамоїл)-2-бензімідазолкарбамоїлової кислоти, 2-метоксикарбоніламінобензімідазол, 2-(фурил-(2))-бензімідазол, 2-(тіазоліл-(4))-бензімідазол, N-(1,1,2,2-тетрахлоретилтіо)тетрагідрофталімід, N-трихлорметилтіотетрагідрофталімід, N-трихлорметилтіофталімід,

- діамід N-дихлорфторметилтіо-N',N'-диметил-N-фенілсірчаної кислоти, 5-етокси-3-трихлорметил-1,2,3-тіадіазол, 2-роданметилтіобензтіазол, 1,4-дихлор-2,5-диметоксибензол, 4-(2-хлорфенілгідрозоно)-3-метил-5-ізоксазолон, піридин-2-тіо-1-оксид, 8-гідроксхінолін, відповідно його мідна сіль, 2,3-дигідро-5-карбоксанілід-6-метил-1,4-оксатіін, 2,3-дигідро-5-карбоксанілід-6-метил-1,4-оксатіін-4,4-діоксид, анілід 2-метил-5,6-дигідро-4Н-піран-3-карбонової кислоти, анілід 2-метилфуран-3-карбонової кислоти, анілід 2,5-диметилфуран-3-карбонової кислоти, анілід 2,4,5-триметилфуран-3-карбонової кислоти, циклогексиламід 2,5-диметилфуран-3-карбонової кислоти, амід N-циклогексил-N-метокси-2,5-диметилфуран-3-карбонової кислоти, 2-анілід метилбензойної кислоти, анілід 2-йодбензойної кислоти, N-форміл-N-морфолін-2,2,2-трихлоретилацеталь, піперазин-1,4-ділбіс-1-(2,2,2-трихлоретил)-формамід, 1-(3,4-дихлораніліно)-1-форміламіно-2,2,2-трихлоретан, 2,6-диметил-N-тридецилморфолін, відповідно його солі, 2,6-диметил-N-циклододецилморфолін, відповідно, його солі, N-[3-(п-трет.-бутилфеніл)-2-метилпропіл]-цис-2,6-диметилморфолін, N-[3-(п-трет.-бутилфеніл)-2-метилпропіл]піперидин, 1-[2-(2,4-дихлорфеніл)-4-етил-1,3-діоксолан-2-ілетил]-1Н-1,2,4-триазол, 1-[2-(2,4-дихлорфеніл)-4-Н-пропіл-1,3-діоксолан-2-ілетил]-1Н-1,2,4-триазол, N-(Н-пропіл)-N-(2,4,6-трихлорфеноксиетил)-N'-імідазолілсечовина, 1-(4-хлорфенокси)-3,3-диметил-1-(1Н-1,2,4-триазол-1-іл)-2-бутанон, 1-(4-хлорфенокси)-3,3-диметил-1-(1Н-1,2,4-триазол-1-

іл)-2-бутанол, (2RS, 3RS)-1-[3-(2-хлорфеніл)-2-(4-фторфеніл)-оксиран-2-ілметил]-1Н-1,2,4-триазол, α-(2-хлорфеніл)-α-(4-хлорфеніл)-5-піримідинметанол, 5-бутил-2-диметиламіно-4-гідрокси-6-метилпіримідин, біс-(п-хлорфеніл)-3-піридинметанол, 1,2-біс-(3-етоксикарбоніл-2-тіоуреїдо)-бензол, 1,2-біс-(3-метоксикарбоніл-2-тіоуреїдо)бензол,

- стробілурини, такі, як метил-Е-метоксиіміно-[α-(о-толїлокси)-о-толїл]ацетат, метил-Е-2-[2-[6-(2-ціанофенокси)піримідин-4-ілокси]феніл]-3-метоксиакрилат, метил-Е-метоксиіміно-[α-(2-феноксифеніл)]ацетамід, метил-Е-метоксиіміно-[α-(2,5-диметилфенокси)-о-толїл]ацетамід, метил-Е-2-[2-[2-трифторметилпіридил-6-]оксиметил]-феніл]-3-метоксиакрилат, складний метиловий ефір (Е,Е-метоксиіміно-{2-[1-3-(трифторметилфеніл)-етиліденамінооксиметил]-феніл}-оцтової кислоти, метил-N-(2-{[1-(4-хлорфеніл)-1Н-піразол-3-іл]оксиметил}-феніл)N-метоксикарбамат,

- анілінопіримідини, такі, як N-(4,6-диметилпіримідин-2-іл)анілін, N-[4-метил-6-(1-пропініл)піримідин-2-іл]анілін, N-[4-метил-6-циклопропілпіримідин-2-іл]анілін,

- фенілпіроли, такі, як 4-(2,2-дифтор-1,3-бензодіоксол-4-іл)пірол-3-карбонітрил,

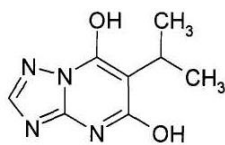
- аміді коричневої кислоти, такі, як морфолід 3-(4-хлорфеніл)-3-(3,4-диметоксифеніл)акрилової кислоти, морфолід 3-(4-фторфеніл)-3-(3,4-диметоксифеніл)акрилової кислоти,

- а також різні фунгіциди, такі, як додецилгуанідинацетат, 1-(бром-6-метокси-2-метилфеніл)-1-(2,3,4-триметокси-6-метилфеніл)метанон, 3-[3-(3,5-диметил-2-оксициклогексил)-2-гідроксіетил]глутарамід, гексахлорбензол, DL-метил-N-(2,6-диметилфеніл)-N-фуроїл(2)аланінат, складний метиловий ефір DL-N-(2,6-диметилфеніл)-N-(2'-метоксиацетил)аланіну, N-(2,6-диметилфеніл)-N-хлорацетил-D,L2-амінобутиролактон, метиловий ефір DL-N-(2,6-диметилфеніл)-N-(фенілацетил)аланіну, 5-метил-5-вініл-3-(3,5-дихлорфеніл)-2,4-діоксо-1,3-оксазолідин, 3-[3,5-дихлорфеніл(-5-метил-5-метоксиметил)-1,3-оксазолідин-2,4-діон, 3-(3,5-дихлорфеніл)-1-ізопропілкарбамоїлгіндантоїн, імід N-(3,5-дихлорфеніл)-1,2-диметил-циклопропан-1,2-дикарбонової кислоти, 2-ціано-[N-(етиламінокарбоніл)-2-метоксиіміно]ацетамід, 1-[2-(2,4-дихлорфеніл)пентил]-1Н-1,2,4-триазол, 2,4-дифтор-α-(1Н-1,2,4-триазоліл-1-метил)-бензгідріловий спирт, N-(3-хлор-2,6-динітро-4-трифторметилфеніл)-5-трифторметил-3-хлор-2-амінопіридин, 1-((біс-(4-фторфеніл)-метилсиліл)метил)-1Н-1,2,4-триазол, диметиламід 5-хлор-2-ціано-4-п-толїл-імідазол-1-сульфокислоти, 3,5-дихлор-N-(3-хлор-1-етил-1-метил-2-оксопропіл)-4-бензамід.

Приклади синтезу

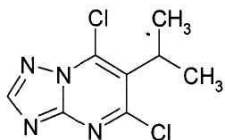
Викладені в нижченаведених прикладах синтезу розпорядження використовують при відповідних відхиленнях для одержання інших сполук формули I. Отримані у такий спосіб сполуки приведені в нижченаведеній таблиці з фізичними даними.

Приклад 1 Одержання 5,7-дигідрокси-6-

ізопропіл-[1,2,4]-триазоло-[1,5- α]-піримідину

Суміш з 14г (0,17моль) 3-аміно-1,2,4-триазолу, 34,3г (0,17моль) діетил-2-ізопропілмалонату та 50мл трибутиламіну перемішують протягом 6 годин при 180°C. Потім реакційну суміш охолоджують до 70°C, додають до неї водний розчин гідроксиду натрію (21г/200мл води) та перемішують протягом 30 хвилин. Органічну фазу відокремлюють та водну фазу екстрагують простим діетиловим ефіром. Після цього водну фазу підкисляють концентрованою соляною кислотою та осад, який утворився, збирають фільтрацією. Після сушіння одержують 27г (0,14моль) зазначеної в заголовку сполуки.

Приклад 2 Одержання 5,7-дихлор-6-ізопропіл-[1,2,4]-триазоло-[1,5- α]-піримідину



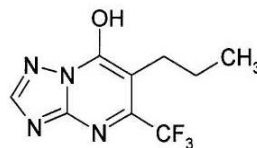
Суміш з 25г (0,13моль) 5,7-дихлор-6-ізопропіл-[1,2,4]-триазоло[1,5- α]-піримідину (порівн. приклад 1) та 50мл фосфороксихлориду нагрівають зі зворотним холодильником протягом 8 годин. Після цього фосфороксихлорид частково відганяють та залишок виливають у суміш з метиленхлориду та води. Органічну фазу відокремлюють, сушать та фільтрують. Фільтрат звільняють від розчинника. Одержують 16г (0,07моль) зазначеної в заголовку сполуки (точка плавлення 119°C).

Приклад 3 Одержання 5-хлор-6-ізопропіл-7-циклопентиламіно-[1,2,4]-триазоло-[1,5- α]-піримідину



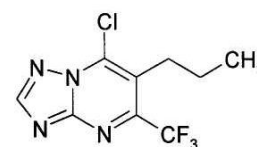
Суміш з 0,13г (1,5ммоль) циклопентиламіну, 0,15г (1,5ммоль) триетиламіну в 10мл метиленхлориду при перемішуванні подають до суміші з 0,34г (1,5ммоль) 5,7-дихлор-6-ізопропіл-[1,2,4]-триазоло-[1,5- α]-піримідину (порівн. приклад 2) у 20мл метиленхлориду. Реакційну суміш при кімнатній температурі перемішують протягом 16 годин та після цього підкисляють за допомогою 5%-ої соляної кислоти. Органічну фазу відокремлюють, сушать над сульфатом натрію та фільтрують. Фільтрат звільняють від розчинника, залишок хроматографічно очищують. Одержують 0,32г (1,14ммоль) зазначеної в заголовку сполуки (точка плавлення 139°C).

Приклад 4 Одержання 7-гідрокси-6-пропіл-5-трифторметил-[1,2,4]-триазоло[1,5- α]-піримідину



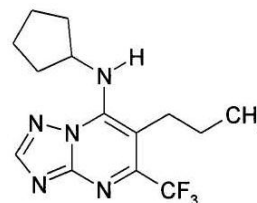
Суміш з 14г (0,17моль) 3-аміно-1,2,4-триазолу, 38,4г (0,17моль) 3-оксо-2-пропіл-4,4,4-трифторобутаноату та 50мл трибутиламіну перемішують протягом 6 годин при 180°C. Обробку здійснюють аналогічно прикладу 1. Після сушіння одержують 33г (0,13моль) зазначеної в заголовку сполуки.

Приклад 5 Одержання 7-хлор-6-пропіл-5-трифторметил-[1,2,4]-триазоло-[1,5- α]-піримідину



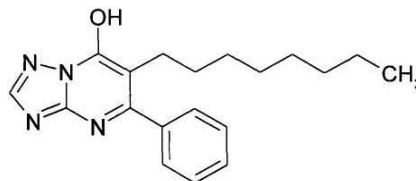
Суміш з 25г (0,10моль) 5,7-дихлор-6-ізопропіл-[1,2,4]-триазоло[1,5- α]-піримідину (порівн. приклад 4) та 50мл фосфороксихлориду нагрівають зі зворотним холодильником аналогічно прикладу 2. Одержують 23г (0,086моль) зазначеної в заголовку сполуки (точка плавлення 63°C).

Приклад 6 Одержання 7-циклопентиламіно-6-пропіл-5-трифторметил-[1,2,4]-триазоло-[1,5- α]-піримідину



Суміш з 0,13г (1,5ммоль) циклопентиламіну, 0,15г (1,5ммоль) триетиламіну в 10мл метиленхлориду додають при перемішуванні до суміші з 0,40г (1,5ммоль) 7-хлор-6-пропіл-5-трифторметил-[1,2,4]-триазоло-[1,5- α]-піримідину (порівн. приклад 5) у 20мл метиленхлориду. Реакційну суміш перемішують протягом 16 годин, переробку здійснюють аналогічно прикладу 3. Одержують 0,39г (1,24ммоль) зазначеної в заголовку сполуки (точка плавлення 179°C).

Приклад 7 Одержання 7-гідрокси-6-октил-5-феніл-[1,2,4]-триазоло-[1,5- α]-піримідину

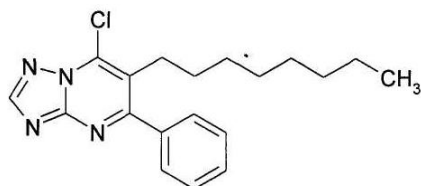


Суміш з 14,0г (0,17моль) 3-аміно-1,2,4-

31

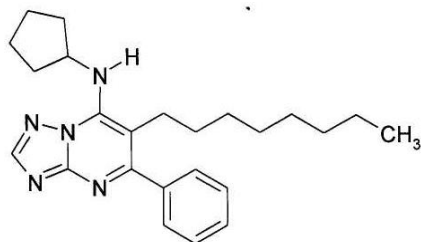
триазолу, 51,7г (0,17моль) 3-оксо-2-октил-4-фенілбутаноату та 3г п-толуолсульфокислоти нагрівають зі зворотним холодильником. Переробку здійснюють аналогічно прикладу 1. Одержують 37г (0,11моль) зазначеної в заголовку сполуки.

Приклад 8 Одержання 7-хлор-6-октил-5-феніл-[1,2,4]-триазоло-[1,5- α]-піримідину



Суміш з 17г (0,05моль) 7-гідрокси-6-октил-5-феніл-[1,2,4]-триазоло-[1,5- α]-піримідину (порівн. приклад 7) та 50мл фосфороксихлориду нагрівають зі зворотним холодильником протягом 8 годин. Переробку здійснюють аналогічно прикладу 2. Одержують 16г (0,046моль) зазначеної в заголовку сполуки.

Приклад 9 Одержання 7-циклопентиламіно-6-октил-5-феніл-[1,2,4]-триазоло-(1,5- α)-піримідину

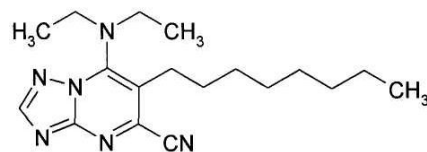


Суміш з 0,13г (1,5ммоль) циклопентиламіну, 0,15г (1,5ммоль) триетиламіну в 10мл метиленхлориду при перемішуванні подають до суміші з 0,52г (1,5ммоль) 7-хлоро-6-октил-5-феніл-[1,2,4]-триазоло-[1,5- α]-піримідину (порівн. приклад 8) у 20мл метиленхлориду. Реакційну суміш перемішують при кімнатній температурі протягом 16 годин, переробку здійснюють аналогічно прикладу 3. Одержують 0,52г (1,3ммоль) зазначеної в заголовку сполуки (точка плавлення 81°C).

76486

32

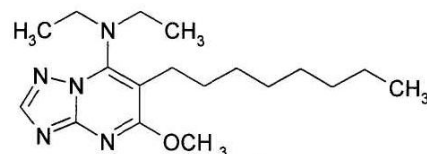
Приклад 10 Одержання 5-ціано-6-октил-7-діетиламіно-[1,2,4]-триазоло-[1,5- α]-піримідину [I-167]



Суміш з 0,1моля сполуки I-48 та 0,25моля ціаніду тетраетиламонію в 750мл диметилформаміду перемішують протягом 16 годин при температурі від 20 до 25°C. Після додавання води та метилтрет.-бутилового ефіру розділяють фази. Органічну фазу після промивання водою та сушіння звільняють від розчинника. Із залишку після хроматографії на силікагелі одержують 8,33г зазначеної в заголовку сполуки.

¹H-ЯМР: δ у міл. дол.: 8,5 (s); 3,65 (q); 2,9 (m); 1,7 (m); 1,3 (m); 1,2 (t); 0,9 (t).

Приклад 11 Одержання 5-метокси-6-октил-7-діетиламіно-[1,2,4]-триазоло[1,5- α]-піримідину [I-168]



Розчин з 65ммоль сполуки I-48 у 400мл безводного метанолу змішують при температурі від 20 до 25°C з 71,5ммоль 30%-го розчину метанолату натрію. Потім реакційну суміш перемішують протягом 16 годин при температурі від 20 до 25°C. Після відгону розчинника залишок завантажують у дихлорметан. Реакційний розчин промивають водою, сушать та звільняють від розчинника. Після хроматографії на силікагелі одержують 7,5г вказаної у заголовку сполуки.

¹H-ЯМР: δ у міл. дол.: 8,18 (s); 4,09 (s); 3,41 (q); 2,65 (m); 1,55 (m); 1,3 (m); 1,1 (t); 0,9 (t).

Таблиця 1

№	R ¹	R ²	R ³	X	Фіз. дані (Тпл. [°C]; IR [см ⁻¹]; ¹ H-ЯМР δ [міл.дол.])
I-1	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	Cl	169
I-2	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CH ₃	Cl	125
I-3	циклопентил	H	CH ₃	Cl	172
I-4	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	CH ₃	Cl	96
I-5	CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₃	Cl	209
I-6	CH ₂ -CF ₃	H	CH ₃	Cl	133
I-7	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	Cl	55
I-8	CH(CH ₃) ₂		CH ₂ -CH ₃	Cl	152
I-9	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CH ₂ -CH ₃	Cl	1543, 1521, 1451
I-10	циклопентил	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	136
I-11	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	Cl	1596, 1511, 1464
I-12	(CH ₂) ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	Cl	1595, 1511, 1456
I-13	CH-(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ -CH ₃	Cl	1593, 1513, 1097
I-14	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	145

I-15	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	140
I-16	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	140
I-17	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	119
I-18	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	102
I-19	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	102
I-20	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	116
I-21	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	1613, 1555, 1464
I-22	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	1612, 1554, 1464
I-23	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	169
I-24	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	140
I-25	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	140
I-26	H	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	263
I-27	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		(CH ₂) ₃ -CH ₃	Cl	91
I-28	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	(CH ₂) ₃ -CH ₃	Cl	125
I-29	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	(CH ₂) ₃ -CH ₃	Cl	121
I-30	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	(CH ₂) ₃ -CH ₃	Cl	121
I-31	CH ₂ -CF ₃	H	(CH ₂) ₃ -CH ₃	Cl	156
I-32	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	H	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	Cl	180
I-33	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	Cl	127
I-34	циклопентил	H	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	Cl	56
I-35	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	Cl	163
I-36	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	Cl	159
I-37	CH(CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	Cl	180
I-38	циклопентил	H	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	Cl	127
I-39	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	Cl	56
I-40	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	Cl	163
I-41	CH ₂ -CF ₃	H	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	Cl	159
I-42	CH(CH ₃) ₂	H	C(CH ₃) ₃	Cl	136
I-43	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		C(CH ₃) ₃	Cl	140
I-44	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2927, 1597, 1508, 1462
I-45	CH(CH ₃) ₂	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2926, 1613, 1553, 1464
I-46	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2925, 1594, 1520, 1192
I-47	циклопентил	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2927, 1612, 1554, 1059
I-48	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2927, 1598, 1511, 1466
I-49	(CH ₂) ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2927, 1597, 1561, 1457
I-50	CH-(CH ₃) ₂	CH ₃	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2926, 1595, 1514, 1467
I-51	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2926, 1613, 1553, 1464
I-52	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2926, 1612, 1553, 1464
I-53	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2926, 1612, 1552, 1463
I-54	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2926, 1613, 1555, 1464
I-55	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2926, 1613, 1556, 1467
I-56	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	2925, 1612, 1556, 1466
I-57	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	1619, 1533, 1146
I-58	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	1620, 1542, 1146
I-59	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	1619, 1541, 1146
I-60	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	CH(CH ₃) ₂	Cl	71
I-61	CH(CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	180
I-62	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	CH(CH ₃) ₂	Cl	91
I-63	(CH ₂) ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CH(CH ₃) ₂	Cl	1592, 1506, 1454
I-64	CH-(CH ₃) ₂	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	Cl	85
I-65	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	1616, 1544, 1463
I-66	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	160
I-67	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	160
I-68	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	134
I-69	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	120
I-70	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	120
I-71	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	2964, 1611, 1551
I-72	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	64
I-73	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	64
I-74	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	1616, 1527, 1147
I-75	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	70

I-76	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	70
I-77	H	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	271
I-78	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	циклопентил	Cl	66
I-79	CH(CH ₃) ₂	H	циклопентил	Cl	136
I-80	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	циклопентил	Cl	78
I-81	(CH ₂) ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₂ -CH ₃	циклопентил	Cl	87
I-82	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	циклогексил	Cl	136
I-83	CH(CH ₃) ₂	H	циклогексил	Cl	156
I-84	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		циклогексил	Cl	151
I-85	циклопентил	H	циклогексил	Cl	158
I-86	CH ₂ -CH ₃	CH ₃ -CH ₃	циклогексил	Cl	103
I-87	(CH ₂) ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₂ -CH ₃	циклогексил	Cl	139
I-88	CH-(CH ₃) ₂	CH ₃	циклогексил	Cl	134
I-89	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	циклогексил	Cl	155
I-90	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	циклогексил	Cl	155
I-91	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	циклогексил	Cl	155
I-92	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	циклогексил	Cl	114
I-93	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	циклогексил	Cl	110
I-94	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	циклогексил	Cl	110
I-95	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	циклогексил	Cl	134
I-96	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	циклогексил	Cl	116
I-97	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	циклогексил	Cl	116
I-98	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	циклогексил	Cl	160
I-99	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	циклогексил	Cl	130
I-100	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	циклогексил	Cl	130
I-101	CH ₂ -CF ₃	H	циклогексил	Cl	167
I-102	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CH ₂ -C ₆ H ₅	Cl	144
I-103	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -(2-Cl-C ₆ H ₄)	Cl	114
I-104	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CH ₂ -(2-Cl-C ₆ H ₄)	Cl	164
I-105	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	55
I-106	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	37
I-107	циклопентил	H	CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	43
I-108	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	циклопропіл-метил	Cl	150
I-109	CH ₂ -CF ₃	H	циклопропіл-метил	Cl	144
I-110	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CH ₂ -CN	Cl	211
I-111	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CF ₃	Cl	84
I-112	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	151
I-113	циклопентил	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	163
I-114	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CF ₃	Cl	103
I-115	(CH ₂) ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CH ₂ -CF ₃	Cl	107
I-116	CH-(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ -CF ₃	Cl	88
I-117	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	131
I-118	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	126
I-119	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	126
I-120	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	114
I-121	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	112
I-122	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	112
I-123	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	110
I-124	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	105
I-125	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	105
I-126	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	179
I-127	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	125
I-128	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	125
I-129	H	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	243
I-130	CH(CH ₃) ₂	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	CF ₃	91
I-131	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		(CH ₂) ₇ -CH ₃	CF ₃	64
I-132	циклопентил	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	CF ₃	84
I-133	H	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	CF ₃	177
I-134	CH(CH ₃) ₂	H	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CF ₃	162
I-135	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		(CH ₂) ₂ -CH ₃	CF ₃	108
I-136	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CF ₃	101

37			76486		38
I-137	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CF ₃	101
I-138	H	H	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CF ₃	241
I-139	CH(CH ₃) ₂	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	C ₆ H ₅	83
I-140	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		(CH ₂) ₇ -CH ₃	C ₆ H ₅	63
I-141	H	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	C ₆ H ₅	163
I-142	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		циклопентил	Cl	2960, 1610, 1550, 1241
I-143	циклопентил	H	циклопентил	Cl	154
I-144	CH-(CH ₃) ₂	CH ₃	циклопентил	Cl	2958, 1610, 1548, 1239
I-145	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	циклопентил	Cl	143
I-146	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	циклопентил	Cl	137
I-147	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	циклопентил	Cl	137
I-148	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	циклопентил	Cl	124
I-149	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	циклопентил	Cl	110
I-150	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	циклопентил	Cl	110
I-151	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	циклопентил	Cl	113
I-152	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	циклопентил	Cl	2962, 1610, 1550, 1241
I-153	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	циклопентил	Cl	2960, 1610, 1549, 1241
I-154	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	циклопентил	Cl	129
I-155	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	циклопентил	Cl	135
I-156	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	циклопентил	Cl	135
I-157	H	H	CH(CH ₃)-(CH ₂) ₅ -CH ₃	CF ₃	129
I-158	H	H	(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃) ₂	CF ₃	213
I-159	H	H	(CH ₂) ₆ -CH ₃	CF ₃	180
I-160	H	H	(CH ₂) ₅ -CH ₃	CF ₃	208
I-161	H	H	CH(CH ₂ CH ₃)-(CH ₂) ₃ -CH ₃	CF ₃	162
I-162	H	H	CH(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂	CF ₃	164
I-163	H	H	CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -CH ₃	CF ₃	148
I-164	H	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	277
I-165	H	H	циклопентил	Cl	8,4 (s); 8,2 (m); 3,45 (m); 1,95 (m); 1,8 (m); 1,6 (m)
I-166	H	H	циклогексил	Cl	8,45 (s); 8,2 (m); 3,1 (m); 2,1 (m); 1,8 (m); 1,55 (m); 1,4 (m)
I-167	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₇ -CH ₃	CN	див. приклад 10
I-168	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₇ -CH ₃	OCH ₃	див. приклад 11

Приклади дії проти фітопатогенних грибів
Фунгіцидну дію сполук загальної формули I можна показати на нижченаведених дослідях.

З діючих речовин, по окремість або разом, були створені композиції у вигляді 10% емульсії у суміші 70мас.% циклогексанону, 20мас.% Nekanil® LN (Lutensol® AP6, змочувальний агент на основі етоксильованих алкілфенолів, який має властивості емульгатора та диспергатора) та 10мас.% Wettol® EM (неіоногенний емульгатор на основі етоксильованої касторової олії) та розведені водою до необхідної концентрації.

Приклад застосування 1 - Ефективність проти Botrytis cinerea на листах перцю

Паростки перцю сорту "Neusiedler Ideal Elite", після розвитку 4-5 листів, обприскують до утворення крапель водною композицією діючої речовини, яка складається з основного розчину з 10% діючої речовини, 85% циклогексанону та 5% емульгатора. Наступного дня оброблені рослини інюкують суспензією спор Botrytis cinerea, яка містить $1,7 \times 10^6$ спор/мл у 2%-ому розчині біосолюда. Після цього рослини, які досліджують, поміщають у кліматичну камеру з температурою від 22 до 24°C і з високою вологістю повітря. Через 5 днів можна візуально встановлювати ступінь ураження фітопатогенними грибами у %. У цьому тесті оброблені 250мл.дол. діючої речовини I-10,

I-61, I-65, I-66, I-68, I-69, I-76, I-78, I-84, I-100, I-101, I-146 та від I-153 до I-155 рослини не мали зовсім або ж мали до 15% ураження, у той час як необроблені рослини мали ураження до 90%.

Приклад застосування 2 - Ефективність проти несправжньої борошнистої роси на виноградній лозі (Plasmopara viticola)

Листи вирощеної у горщиках виноградної лози сорту "Muller-Thurgau" обприскують до утворення крапель композицією діючої речовини, яка складається з основного розчину з 10% діючої речовини, 85% циклогексанону та 5% емульгатора. Наступного дня листи інюкують водною суспензією зооспор Plasmopara viticola. Після цього рослини поміщають спочатку на 48 годин у насичену водною парою камеру при температурі у 24°C і потім на 5 днів у теплицю при температурі між 20 та 30°C. Після закінчення цього часу для прискорення викиду спорангієносця рослини поміщають ще на 16 годин у вологу камеру. Після цього можна було візуально визначати ступінь ураження на нижній стороні листів.

У цьому тесті оброблені 250мл.дол. діючої речовини від I-8 до I-10, I-19, I-25, I-27, I-49, від I-60 до I-62, I-69, I-84, I-101, I-113, I-133, I-146, та від I-153 до I-155 рослини не мали ураження або мали тільки до 15% ураження, у той час як необроблені рослини мали ураження до 85%.

