



(19) **UA** (11) **79 266** (13) **C2**
(51)МПК

МИНИСТЕРСТВО ОБРАЗОВАНИЯ И НАУКИ
УКРАИНЫ

ГОСУДАРСТВЕННЫЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ УКРАИНЫ

(21), (22) Заявка: 20040907251, 22.01.2003

(24) Дата начала действия патента: 11.06.2007

(30) Приоритет: 04.02.2002 DE 102 04 391.4

(46) Дата публикации: 11.06.2007 C07D 277/20

20070101AFI20070115RMUA C07D 277/56

20070101ALI20070115RMUA A01N 43/78

20070101ALI20070115RMUA A01P 3/00

20070101CLI20070115BNUA

(86) Заявка PCT:

PCT/EP03/00589, 20030122

(72) Изобретатель:

Эльбе Ханс-Людвиг, DE,

Рикк Хайко, DE,

Дункель Ральф, DE,

Вахендорфф-Нойманн Ульрике, DE,

Кукк Карл-Хайнц, DE,

Маулер-Махник Астрид, DE,

Куглер Мартин, DE,

Еч Томас, DE,

Вахтлер Петер, DE

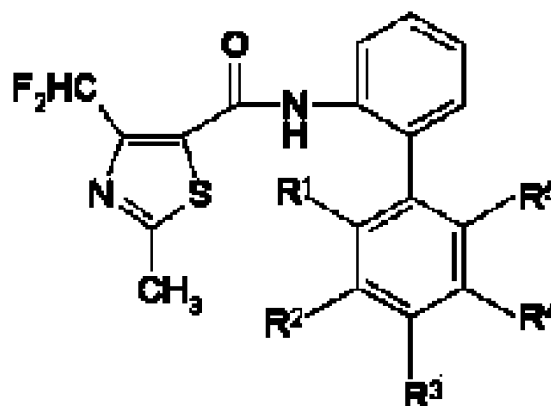
(73) Патентовладелец:

БАЕР КРОПСАЕНС АКЦИЕНГЕЗЕЛЬШАФТ, DE

(54) ДИФТОРМЕТИЛТИАЗОЛИЛКАРБОКСАНИЛИДЫ, СРЕДСТВО И СПОСОБ БОРЬБЫ С
НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫМИ МИКРООГАНИЗМАМИ

(57) Реферат:

Дифторметилтиазолилкарбоксанилиды
формулы (I), в которой R^1 означает водород,
галоген или C_1 - C_6 -алкил, R^2 - водород, галоген,
 C_1 - C_6 -алкил или C_1 - C_4 -галогеналкил, R^3 -
водород, галоген, C_1 - C_6 -алкил,
 C_1 - C_4 -галогеналкил, C_1 - C_4 -галогеналкокси или
 C_1 - C_4 -галогеналкилтио, R^4 - водород или
галоген, R^5 означает водород, и их применение
для борьбы с нежелательными микроорганизмами.



(I).

Официальный бюллетень "Промышленная
собственность". Книга 1 "Изобретения, полезные
модели, топографии интегральных микросхем",
2007, N 8, 11.06.2007. Государственный
департамент интеллектуальной собственности
Министерства образования и науки Украины.



(19) **UA** (11) **79 266** (13) **C2**
(51) Int. Cl.

MINISTRY OF EDUCATION AND SCIENCE OF
UKRAINE

STATE DEPARTMENT OF INTELLECTUAL
PROPERTY

(12) DESCRIPTION OF PATENT OF UKRAINE FOR INVENTION

(21), (22) Application: 20040907251, 22.01.2003

(24) Effective date for property rights: 11.06.2007

(30) Priority: 04.02.2002 DE 102 04 391.4

(46) Publication date: 11.06.2007 C07D 277/20

20070101AFI20070115RMUA C07D 277/56

20070101ALI20070115RMUA A01N 43/78

20070101ALI20070115RMUA A01P 3/00

20070101CLI20070115BHUA

(86) PCT application:
PCT/EP03/00589, 20030122

(72) Inventor:

ELBE HANS-LUDWIG, DE,
RIECK HEIKO, DE,
DUNKEL RALF, DE,
WACHENDORFF-NEUMANN ULRIKE, DE,
KUCK KARL-HEINZ, DE,
MAULER-MACHNIK ASTRID, DE,
KUGLER MARTIN, DE,
JAETSCH THOMAS, DE,
WACHTLER PETER, DE

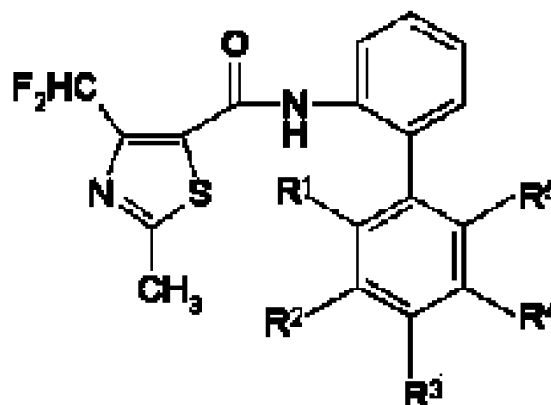
(73) Proprietor:

BAYER CROPSCIENCE
AKTIENGESELLSCHAFT, DE

(54) difluoromethyl thiazolyl carboxanilides, and agent and a method for controlling undesired microorganisms

(57) Abstract:

The invention relates to the novel difluoromethyl thiazolyl carboxanilides of formula (I), wherein R^1 , R^2 , R^3 , R^4 and R^5 are defined as in the description. The invention also relates to several methods for producing said substances and to their use for controlling undesired microorganisms, as well as to novel intermediates and their production.



(I).

Official bulletin "Industrial property". Book 1 "Inventions, utility models, topographies of integrated circuits", 2007, N 8, 11.06.2007. State Department of Intellectual Property of the Ministry of Education and Science of Ukraine.



(19) **UA** (11) **79 266** (13) **C2**
(51)МПК

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ ВЛАСНОСТІ

(12) ОПИС ВІНАХОДУ ДО ПАТЕНТУ УКРАЇНИ

(21), (22) Дані стосовно заявки:

20040907251, 22.01.2003

(24) Дата набуття чинності: 11.06.2007

(30) Дані стосовно пріоритету відповідно до Паризької конвенції : 04.02.2002 DE 102 04 391.4

(46) Публікація відомостей про видачу патенту

(деклараційного патенту): 11.06.2007 C07D 277/20

20070101AFI20070115RMUA C07D 277/56

20070101ALI20070115RMUA A01N 43/78

20070101ALI20070115RMUA A01P 3/00

20070101CLI20070115BNUA

(86) Номер та дата подання міжнародної заявки

відповідно до договору PCT:

PCT/EP03/00589, 20030122

(72) Винахідник(и):

Ельбе Ханс-Людвіг, DE,

Рікк Хайко, DE,

Дункель Ральф, DE,

Вахендорфф-Нойманн Ульріке, DE,

Кукк Карл-Хайнц, DE,

Маулер-Махнік Астрід, DE,

Куглер Мартін, DE,

Єч Томас, DE,

Вахтлер Петер, DE

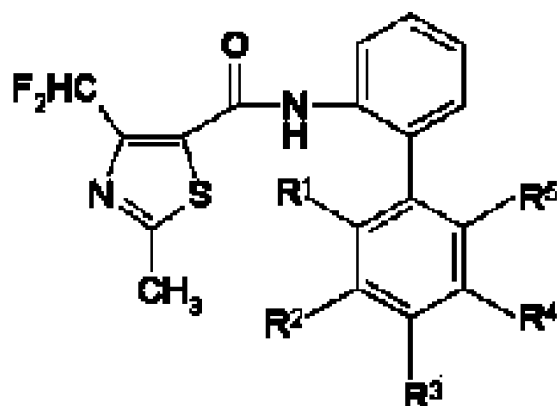
(73) Власник(и):

БАСР КРОПСАЄНС АКЦІЕНГЕЗЕЛЬШАФТ, DE

(54) ДИФТОРМЕТИЛТІАЗОЛІЛКАРБОКСАНІЛІДИ, ЗАСІБ ТА СПОСІБ БОРОТЬБИ З НЕБАЖАНИМИ МІКРООРГАНІЗМАМИ

(57) Реферат:

Дифторметилтіазолілкарбоксаніліди формули (I), в якій R¹ означає водень, галоген або C₁-C₆-алкіл, R² - водень, галоген, C₁-C₆-алкіл або C₁-C₄-галогеналкіл, R³ - водень, галоген, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-галогеналкокси або C₁-C₄-галогеналкілтіо, R⁴ - водень або галоген, R⁵ означає водень, та їх застосування для боротьби з небажаними мікроорганізмами.



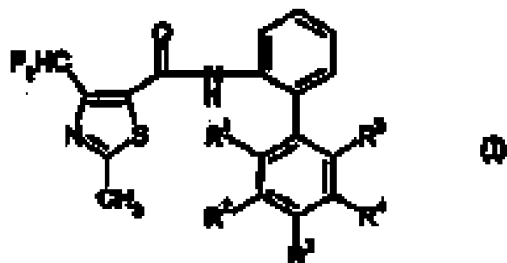
(I).

Опис винаходу

Даний винахід стосується нових диформетилтіазолілкарбоксанлідів, кількох способів їх одержання та їх застосування для боротьби зі шкідливими мікроорганізмами у захисті рослин та матеріалів.

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

Були описані нові диформетилтіазолілкарбоксаніліди формули (I)



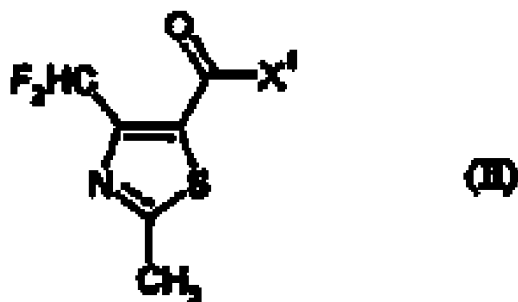
в якій

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 незалежно один від одного означають водень, галоген, ціано, нітро, C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -алкілтію, C_1 - C_4 -алкілсульфоніл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, або C_1 - C_4 -галогеналкіл, C_1 - C_4 -галогеналкокси, C_1 - C_4 -галогеналкілтію або C_1 - C_4 -галогеналкілсульфоніл, що містять відповідно 1-5 атомів галогену, за умови, що R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 одночасно не означають водень,

R^1 та R^2 або R^2 та R^3 крім того разом означають, в разі необхідності, заміщений галогеном або C_1 - C_4 -алкілом алкенілен.

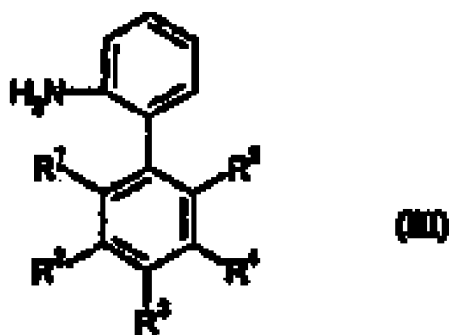
Крім того з'ясували, що диформетилтіазолілкарбоксаніліди формули (I) одержують

а) шляхом взаємодії галогенідів диформетилтіазолілкарбонової кислоти формули (II)



в якій

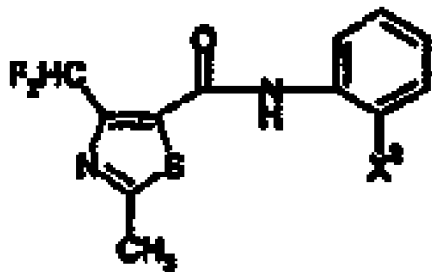
X^1 означає галоген,
з похідними аніліну формули (III)



в якій

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 мають вказані вище значення,
в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоту, та, в разі необхідності, в присутності розріджувача, або

б) шляхом взаємодії диформетилтіазолілкарбоксгалогенанлідів формули (IV)

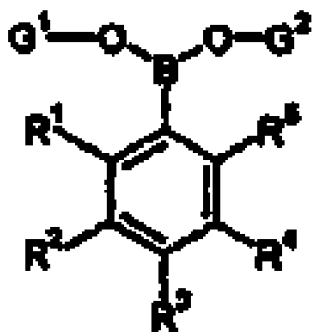


(IV)

в якій

X^2 означає бром або йод,

з похідними борної кислоти формули (V)



(V)

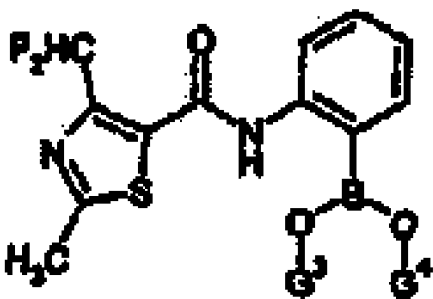
в якій

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

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

в присутності каталізатора, в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоту, та, в разі необхідності, в присутності розріджувача, або

с) шляхом взаємодії похідних диформетилтіазолілкарбоксанілідборної кислоти формули (VI)

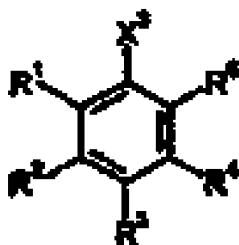


(VI)

в якій

G^3 та G^4 відповідно означають водень або разом означають тетраметилетилен,

з похідними галогенбензолу формули (VII)



(VII)

в якій

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

X^3 означає бром, йод або трифторметилсульфонілокси,

в присутності каталізатора, в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоту, та, в разі необхідності, в присутності розріджувача.

Крім того з'ясували, що нові диформетилтіазолілкарбоксаніліди формули (I) проявляють дуже високі бактерицидні властивості та можуть бути застосовані для боротьби з небажаними мікроорганізмами як у захисті рослин, так і у захисті матеріалів.

Крім того найбільшу перевагу надають дифторметилтіазолілкарбоксанілідам формули (I), в якій R², R⁴ та R⁵ відповідно означають водень та

R¹ та R³ незалежно один від одного означають фтор, хлор, бром, метил або трифторметил.

Крім того найбільшу перевагу надають дифторметилтіазолілкарбоксанілідам формули (I), в якій R¹, R⁴ та R⁵ відповідно означають водень та

R² та R³ незалежно один від одного мають вказані вище значення.

Крім того найбільшу перевагу надають дифторметилтіазолілкарбоксанілідам формули (I), в якій R¹, R⁴ та R⁵ відповідно означають водень та

R² та R³ незалежно один від одного означають фтор, хлор, бром, метил або трифторметил.

Крім того найбільшу перевагу надають дифторметилтіазолілкарбоксанілідам формули (I), в якій R¹, R³ та R⁵ відповідно означають водень та

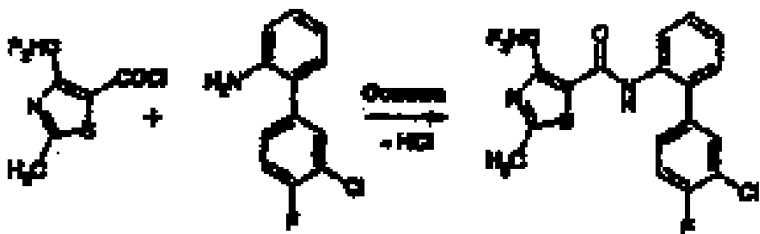
R² та R⁴ незалежно один від одного мають вказані вище значення.

Крім того найбільшу перевагу надають дифторметилтіазолілкарбоксанілідам формули (I), в якій R¹, R³ та R⁵ відповідно означають водень та

R² та R⁴ незалежно один від одного означають фтор, хлор, бром, метил або трифторметил.

Крім того найбільшу перевагу надають також дифторметилтіазолілкарбоксанілідам формули (I), в якій R⁵ означає водень.

Якщо як вихідні речовини застосовують 2-метил-4-(дифторметил)-1,3-тіазол-5-карбонілхлорид та 3'-хлор-4'-фтор-1,1'-біфеніл-2-амін, а також основу, то згідно з винаходом наведена нижче схема демонструє здійснення способу а):



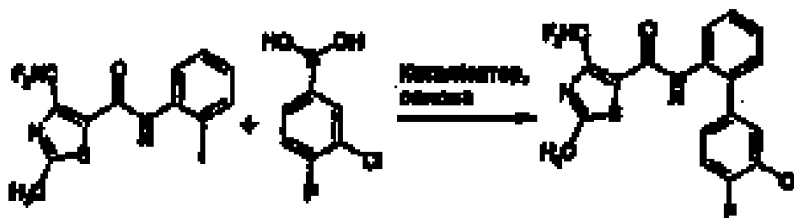
Галогеніди дифторметилтіазолілкарбонової кислоти, які як вихідні речовини необхідні для здійснення способу а) згідно з винаходом, загалом визначаються формулою (II). В цій формулі (II) X¹ переважно означає хлор.

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

Аніліни, які як вихідні речовини необхідні для здійснення способу а) згідно з винаходом, загалом визначаються формулою (III). В цій формулі (III) R¹, R², R³, R⁴ та R⁵ переважно або особливо переважно мають значення, вказані при описанні сполук формули (I) згідно з винаходом та визначені як переважні або особливо переважні для цих залишків.

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

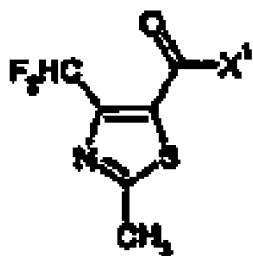
Якщо як застосовують N-(2-йодфеніл)-2-метил-4-(дифторметил)-1,3-тіазол-5-карбоксамід та 3-хлор-4-фторфенілборну кислоту, а також каталізатор та основу, то згідно з винаходом наведена нижче схема демонструє здійснення способу b):



Галогеніди дифторметилтіазолілкарбонової кислоти, які як вихідні речовини необхідні для здійснення способу b) згідно з винаходом, загалом визначаються формулою (IV). В цій формулі (IV) X² переважно означає бром або йод.

Галогеніди дифторметилтіазолілкарбонової кислоти формули (IV) ще не відомі. Вони є новими хімічними сполуками, а також об'єктом даного винаходу. Їх одержують шляхом

d) взаємодії галогенідів дифторметилтіазолілкарбонової кислоти формули (II)



(II)

в якій

X¹ означає галоген,

з 2-броманіліном або 2-йоданіліном.

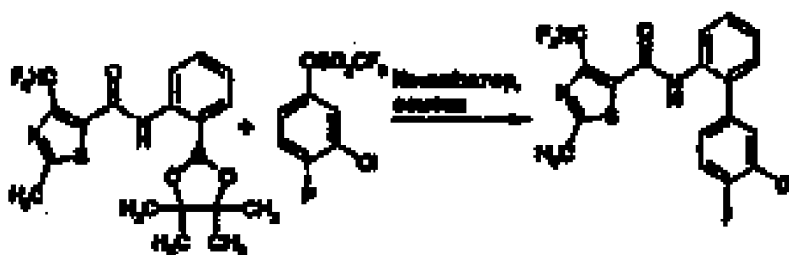
Галогеніди диформетилтіазолілкарбонової кислоти формули (II), які як вихідні речовини необхідні для здійснення способу d) згідно з винаходом, були описані вище у способі а) згідно з винаходом.

2-броманілін або 2-йоданілін, які як вихідні речовини є необхідними для здійснення способу d) згідно з винаходом, представляють собою відомі хімічні продукти синтезу.

Похідні борної кислоти, які як вихідні речовини є необхідними для здійснення способу b) згідно з винаходом, загалом визначаються формулою (V). В цій формулі (V) R¹, R², R³, R⁴ та R⁵ переважно або особливо переважно мають значення, вказані при описанні сполук формули (I) згідно з винаходом та визначені як переважні або особливо переважні для цих залишків. G¹ та G² переважно відповідно означають водень або разом означають тетраметилетилен.

Похідні борної кислоти формули (V) є відомими хімічними продуктами синтезу. Вони можуть бути одержані також безпосередньо перед проведенням реакції із похідних галогенбензолу та естерів борної кислоти та без попередньої обробки вступати у взаємодію (див. також приклади одержання).

Якщо як вихідні речовини застосовують 2-метил-N-[2-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолан-2-іл)феніл]-4-(диформетил)-1,3-тіазол-5-карбоксамід та 3-хлор-4-фтор-фенілтрифторметансульфонову кислоту, а також каталізатор та основу, то згідно з винаходом наведена нижче схема демонструє здійснення способу c):



Похідні диформетилтіазолілкарбоксанлідборної кислоти, які як вихідні речовини є необхідними для здійснення способу c), загалом визначаються формулою (VI). В цій формулі (VI) G³ та G⁴ переважно відповідно означають водень або разом означають тетраметилетилен.

Похідні диформетилтіазолілкарбоксанлідборної кислоти формули (VI) ще не відомі. Вони є новими хімічними сполуками, а також об'єктом даного винаходу. Їх одержують шляхом

е) взаємодії галогенідів диформетилтіазолілкарбонової кислоти формули (II)

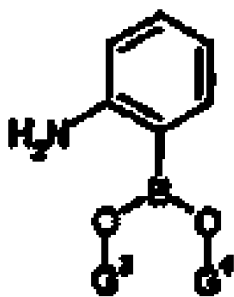


(VI)

в якій

X¹ означає галоген,

з похідними анілінборної кислоти формули (VIII)



в якій

G^3 та G^4 мають вказані вище значення.

в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоту, та, в разі необхідності, в присутності розріджувача.

Галогеніди диформетилпітазолілкарбонової кислоти формули (II), які як вихідні речовини є необхідними для здійснення способу е) згідно з винаходом, вже були описані вище в контексті здійснення способу а) згідно з винаходом.

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

Похідні анілінборної кислоти формули (VIII), які як вихідні речовини є необхідними для здійснення способу е) згідно з винаходом, є відомим хімічними продуктами синтезу.

Похідні галогенбензолу, які як вихідні речовини є необхідними для здійснення способу с) згідно з винаходом, загалом визначаються формулою (VII). В цій формулі (VII) R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 переважно та особливо переважно мають значення, вказані при описанні сполук формули (I) згідно з винаходом та визначені як переважні або особливо переважні для цих залишків. X переважно означає бром, йод або трифторметилсульфоніокси.

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

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

При здійсненні способів а), д) та е) згідно з винаходом реакційні температури можна варіювати у широкому діапазоні. Загалом працюють при температурах від 0°C до 150°C, переважно при температурах від 20°C до 110°C.

При здійсненні способу а) згідно з винаходом для одержання сполук формули (I) на моль галогеніду диформетилтіазолілкарбонової кислоти формули (II) загалом застосовують від 0,2 до 5моль, переважно 0,5-2моль похідних аніліну формули (III).

При здійсненні способу д) згідно з винаходом для одержання сполук формули (III) на моль галогеніду диформетилтіазолілкарбонової кислоти формули (II) загалом застосовують від 0,2 до 5моль, переважно 0,5-2моль 2-броманіліну або 2-йоданіліну.

При здійсненні способу е) згідно з винаходом для одержання сполук формули (VI) на моль галогеніду диформетилтіазолілкарбонової кислоти формули (II) загалом застосовують від 0,2 до 5моль, переважно 0,5-2моль похідних анілінборної кислоти формули (VIII).

Як розріджувач для здійснення способів б) та с) згідно з винаходом застосовують всі інертні органічні розчинники. До них належать переважно аліфатичні, алікличні або ароматичні вуглеводні, такі як, наприклад, петролейний етер, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол або декалін; етери, такі як діетиловий етер, діізопропіловий етер, метил-т-бутиловий етер, метил-т-аміловий етер, діоксан, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксиетан, 1,2-діетоксиетан або анізол; нітрили, такі як ацетонітрил, пропіонітрил, n- або i-бутиронітрил або бензонітрил; аміди, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метилформанлід, N-метилпіролідон або триамід гексаметилфосфорної кислоти; естери, такі як метиловий

естер оцтової кислоти або етиловий естер оцтової кислоти; сульфоксиди, такі як диметилсульфоксид; сульфони, такі як сульфолан; спирти, такі як метанол, етанол, н- або і-пропанол, н-, і-, втор.- або трет-бутанол, етандіол, пропан-1,2-діол, етоксietанол, метоксietанол, монометильовий етер діетиленгліколю, моноетильовий етер діетиленгліколю, їх суміші з водою або чиста вода.

При здійсненні способів б) та с) згідно з винаходом реакційні температури можна варіювати у широкому діапазоні. Загалом працюють при температурах від 0°C до 150°C, переважно при температурах від 20°C до 110°C.

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

Способи и) та с) згідно з винаходом здійснюють в присутності каталізатора, такого як, наприклад, паладієва сіль або комплекс. До них належать переважно хлорид паладію, ацетат паладію, тетракіс(трифенілфосфін)-паладій, дихлорид біс(трифенілфосфін)-паладію або хлорид (1,1'-біс(дифенілфосфін)ферроценпаладію(II)).

Паладієвий комплекс можна також одержати в реакційній суміші шляхом окремого додавання до суміші паладієвої солі та комплексного ліганда, як, наприклад, триетилфосфан, три-трет-бутилфосфан, трициклогексилфосфан, 2-(дициклогексил-фосфан)біфеніл, 2-(ди-трет-бутилфосфан)біфеніл, 2-(дициклогексилфосфан)-2'-(N,N-диметиламіно)біфеніл, трифенілфосфан, трис-(о-толіл)-фосфан, натрій-3-(дифенілфосфіно)бензолсульфонат, трис-2-(метоксифеніл)фосфан, 2,2'-біс-(дифенілфосфан)-1,1'-бінафтил, 1,4-біс-(дифенілфосфан)бутан, 1,2-біс-(дифеніл-фосфан)етан, 1,4-біс-(дициклогексилфосфан)бутан, 1,2-біс-(дициклогексилфосфан)етан, 2-(дициклогексилфосфан)-2'-(N,N-диметиламіно)біфеніл, біс-(дифенілфосфіно)ферроцен або трис-(2,4-трет-бутилфеніл)фосфіт.

При здійсненні способу б) згідно з винаходом для одержання сполук формули (I) на види *Cochliobolus*, наприклад, *Cochliobolus sativus* (форма конідії: *Drechslera*, син.: *Helminthosporium*);

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

Під небажаними мікроорганізмами в даному випадку слід розуміти фітопатогенні грибки, бактерії та віруси.

Отже, речовини згідно з винаходом можуть бути застосовані для захисту рослин від враження вказаними збудниками хвороб протягом певного проміжку часу після обробки. Час, протягом якого діє даний захист, становить загалом від 1 до 10 днів, переважно 1-7 днів після обробки рослин активними речовинами.

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

Активні речовини згідно з винаходом придатні також для підвищення продуктивності врожаю. Крім того вони є менш токсичними та проявляють високу сумісність з рослинами.

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

Згідно з винаходом можуть бути оброблені всі рослини та частини рослин. Під рослинами при цьому

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

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

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

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

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

Необхідно, наприклад, назвати мікроорганізми таких родів:

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

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

Ці композиції одержують відомими способами, наприклад, змішуванням активних речовин з розріджувачами, тобто рідкими розчинниками, розрідженими газами під тиском та/або твердими носіями, в разі необхідності, при застосуванні поверхнево-активних речовин, тобто емульгаторів та/або диспергаторів та/або піноутворюючих речовин. У випадку використання води як розріджувача можуть також бути застосовані, наприклад, органічні розчинники як допоміжні засоби, що поліпшують розчинення. Як рідкі органічні розчинники в основному застосовують: ароматичні сполуки, такі як ксилол, толуол, або алкілнафталіни, хлоровані ароматичні сполуки або хлоровані аліфатичні вуглеводні, такі як хлорбензоли, хлоретилени або метиленхлорид, аліфатичні вуглеводні, такі як циклогексан або парафіни, наприклад, фракції нафти, спирти, такі як бутанол або гліколь, а також їх етери та естери, кетони, такі як ацетон, метилетил кетон, метилізобутилкетон або циклогексанон, сильнополярні розчинники, такі як диметилформамід та диметилсульфоксид, а також воду. Під газоподібними розріджувачами або носіями розуміють такі рідини, які при нормальній температурі та нормальному тиску існують у формі газу, наприклад, аерозолі, такі як галогенвуглеводні, а також бутан, пропан, азот та діоксид вуглецю. Як тверді носії мають на увазі: наприклад, помели природних каменів, таких як каоліни, глиноземи, тальк, крейда, кварц, атапульгіт, монтморилоніт або діатомова земля, та помели синтетичних каменів, такі як високодисперсна кремнієва кислота, оксид алюмінію та силікати. Як тверді носії для гранулятів мають на увазі: наприклад, подрібнені та фракціоновані природні кам'яні породи, такі як кальцит, мармур, пемза, сепіоліс, доломіт, а також синтетичні грануляти з неорганічного або органічного борошна, а також грануляти з органічного матеріалу, такого як тирса, шкарлупа кокосових горіхів, кукурудзяні качани та стебла тютюну. Як

емульгатори та/або піноутворюючі засоби мають на увазі: наприклад, неіоногенні та аніонні емульгатори, такі як поліоксietiленовий естер жирної кислоти, поліоксietiленовий етер жирного спирту, наприклад, алкіларилполігліколевий етер, алкілсульфонати, алкілсульфати, арилсульфонати, а також гідролізати білку, Як диспергуючі засоби мають на увазі: наприклад, відпрацьовані лігнінсульфітні луги та метилцеллюлозу.

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

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

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

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

Фунгіциди:

Алдиморф, ампропілфос, ампропілфос-калій, андоприм, анілазин, азаконазол, азоксистробін, беналаксил, беноданіл, беноміл, бензамакрил, бензамакрил-ізобутил, біалафос, бінапакрил, біфеніл, бітертанол, бластицидин-S, бромуконазол, бупіримат, бутіобат,

полісульфід кальцію, карпропамід, капсиміцин, каптафол, каптан, карбендазин, карбоксин, карвон, хінометіонат (квінометіонат), хлобензтіазон, хлорфеназол, хлоронеб, хлоропикрин, хлороталоніл, хлозолінат, хлозилаккон, куфранеб, цимоксаніл, ципроконазол, ципродиніл, ципрофурам, дебакарб, дихлорофен, диклбутразол, диклофлуанід, дикломецин, диклоран, діетофенкарб, дифеноконазол, диметиримол, диметоморф, диніконазол, диніконазол-М, динокап, дифеніламін, дипіритіон, диталіміфос, дитіанон, додеморф, додін, дразоксолон,

едифенфос, епоксиконазол, етаконазол, етиримол, етридіазол, фамоксадон, фенапаніл, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенгексамід, фенітропан, фенпіклоніл, фенпропідин, фенпропіморф, фентинацетат, фентингідроксид, фербам, феримзон, флуазинам, флуметовер, фтормід, флуквінконазол, флурпримідол, флузилазол, флусульфамід, флутоланіл, флутриафол, фолпет, фозетил-алюміній, фозетил-натрій, фталід, фуберидазол, фуралаксил, фураметпір, фуркарбоніл, фурконазол, фурконазол-цис, фурмециклокс,

гуазатин, гексахлорбензол, гексаконазол, гімексазол, імазалаіл, імібенконазол, іміноктадин, іміноктадинальбесилат, іміноктадинтриацетат, йодокарб, іпконазол, іпробенфос (IBP), іпродіон, іпровалікарб, ірумаміцин, ізопротіолан, ізоваледіон,

казугаміцин, крезоксим-метил, сполуки міді, такі як гідроксид міді, нафтенат міді, оксихлорид міді, сульфат міді, оксид міді, оксин-мідь та бордоска суміш,

манкопер, манкозеб, манеб, меферимзон, мепаніпирим, мепроніл, металаксил, метконазол, метасульфокарб, метфуроксам, метирам, метомеклам, метсульфовакс, мілдіюміцин, миклобутаніл, миклозолін,

диметилдитіокарбамат нікелю, нітротал-ізопропіл, нуаримол, офурак, оксакисил, оксамокарб, оксолінікацид, оксикарбоксим, оксифентіїн,

паклобутразол, пефуразоат, пенконазол, пенцикурон, фосдифен, пікоксистробін, пімарицин, піпералін, поліоксин, поліоксорим, пробеназол, прохлораз, процимідон, пропамокарб, пропанозин-натрій, пропіконазол, пропінеб, піраклостробін, піразофос, пірифенокс, піриметаніл, пірохілон, піроксифур,

хінконазол, хінтоцен (PCNB), хіноксифен, сірка та сполуки сірки, спіроксаміни,

тебуконазол, теклофталам, текназен, тетциклацис, тетраконазол, тіабендазол, тиціофен, тифлузаміди, тіофанат-метил, тирам, тіоксимід, толклофос-метил, толілфлуанід, триадимефон, триадименол, триазбутил, триазоксид, трихламід, трициклазол, тридеморф, трифлуксистробін, трифлумізол, трифорин, тритиконазол,

уніконазол, валідаміцин А, вінклозолін, вініконазол, заріламід, зинеб, зирам, а також Даггер G, ОК-8705, ОК-8801,

α -(1,1-диметилетил)- β -(2-феноксиетил)-1H-1,2,4-триазол-1-етанол,

α -(2,4-дихлорфеніл)- β -фтор- β -пропіл-1H-1,2,4-триазол-1-етанол,

α -(2,4-дихлорфеніл)- β -метокси- α -метил-1H-1,2,4-триазол-1-етанол,

α -(5-метил-1,3-діоксан-5-іл)- β -[[4-(трифторметил)феніл]метилен]-1H-1,2,4-триазол-1-етанол,

(5RS,6RS)-6-гідрокси-2,2,7,7-тетраметил-5-(1H-1,2,4-триазол-1-іл)-3-октанон,

(E- α -(метоксиіміно-N-метил-2-феноксифенілацетамід,

1-(2,4-дихлорфеніл)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-іл)-етанон-O-(фенілметил)оксим,

1-(2-метил-1-нафталеніл)-1H-пірол-2,5-діон,

1-(3,5-дихлорфеніл)-3-(2-пропеніл)-2,5-піролідіндіон,

1-[(дийодметил)сульфоніл]-4-метилбензол,

1-[[2-(2,4-дихлорфеніл)-1,3-діоксолан-2-іл]метил]-1H-імідазол,

1-[[2-(4-хлорфеніл)-3-фенілоксираніл]метил]-1H-1,2,4-триазол,

- 1-[1-2-[(2,4-дихлорфеніл)метокси]феніл]етеніл]-1Н-імідазол,
 1-метил-5-ноніл-2-(фенілметил)-3-піролідинол,
 2',6'-дибром-2-метил-4'-трифторметокси-4'-трифторметил-1,3-тіазол-5-карбоксанілід,
 2,6-дихлор-5-(метилтіо)-4-піридинілітіоціанат,
 2,6-дихлор-N-(4-трифторметилбензил)бензамід,
 2,6-дихлор-N-[[4-(трифторметил)феніл]метил]бензамід,
 2-(2,3,3-триїод-2-пропеніл)-2Н-тетразол,
 2-[(1-метилетил)сульфоніл]-5-(трихлорметил)-1,3,4-тіадіазол,
 2-[[6-деокси-4-О-(4-О-метил-β-D-глікопіранозил)-α
 -D-глюкопіранозил]аміно]-4-метокси-1Н-піроло[2,3-d]піримідин-5-карбоніл,
 2-амінобутан,
 2-бром-2-(бромметил)пентандинітрил,
 2-хлор-N-(2,3-дигідро-1,1,3-триметил-1Н-інден-4-іл)-3-піридинкарбоксамід,
 2-хлор-N-(2,6-диметилфеніл)-N-(ізотіоціанатометил)ацетамід,
 2-фенілфенол (OPP),
 3,4-дихлор-1-[4-(дифторметокси)феніл]-1Н-пірол-2,5-діон,
 3,5-дихлор-N-[ціан[(1-метил-2-пропініл)окси]метил]бензамід,
 3-(1,1-диметилпропіл-1-оксо)-1Н-інден-2-карбонітрил,
 3-[2-(4-хлорфеніл)-5-етокси-3-ізоксазолідиніл]піридин,
 4-хлор-2-ціано-N,N-диметил-5-(4-метилфеніл)-1Н-імідазол-1-сульфонамід,
 4-метилтетразоло[1,5-a]хіназолін-5(4Н)-он,
 8-гідроксигінолінсульфат,
 9Н-ксантен-9-карбонової кислоти 2-[(феніламіно)карбоніл]гідразид,
 біс-(1-метилетил)-3-метил-4-[(3-метилбензоїл)окси]-2,5-тіофендикарбоксилат,
 цис-1-(4-хлорфеніл)-2-(1Н-1,2,4-тріазол-1-іл)циклопентанол,
 гідрохлорид цис-4-[3-[4-(1,1-диметилпропіл)феніл-2-метилпропіл]-2,6-диметил]-морфоліну,
 етил [(4-хлорфеніл)азо]ціаноацетат,
 гідрокарбонат калію,
 натрієва сіль метантетратіолу,
 метил 1-(2,3-дигідро-2,2-диметил-1Н-інден-1-іл)-1Н-імідазол-5-карбоксилат,
 метил N-(2,6-диметилфеніл)-N-(5-ізоксазолілкарбоніл)-DL-аланінат,
 метил N-(хлорацетил)-N-(2,6-диметилфеніл)-DL-аланінат,
 N-(2,6-диметилфеніл)-2-метокси-N-(тетрагідро-2-оксо-3-фураніл)ацетамід,
 N-(2,6-диметилфеніл)-2-метокси-N-(тетрагідро-2-оксо-3-тієніл)ацетамід,
 N-(2-хлор-4-нітрофеніл)-4-метил-3-нітробензолсульфонамід,
 N-(4-циклогексилфеніл)-1,4,5,6-тетрагідро-2-піримідинамін,
 N-(4-гексилфеніл)-1,4,5,6-тетрагідро-2-піримідинамін,
 N-(5-хлор-2-метилфеніл)-2-метокси-N-(2-оксо-3-оксазолідиніл)ацетамід,
 N-(6-метокси)-3-піридиніл)циклопропанкарбоксамід,
 N-[2,2,2-трихлор-1-[(хлорацетил)аміно]етилу]бензамід,
 N-[3-хлор-4,5-біс-(2-пропінілокси)феніл]-N'-метоксиметанімід,
 натрієва сіль N-форміл-N-гідрокси-DL-аланіну,
 О,О-діетил-[2-(дипропіламіно)-2-оксоетил]етилфосфорамідотіат,
 О-метил-3-феніл-фенілпропілфосфорамідотіат,
 S-метил-1,2,3-бензотіадізол-7-карботіоат,
 спіро[2Н]-1-бензопіран-2,1'(3'Н)-ізобензофуран]-3'-он,
 4-[3,4-диметоксифеніл-3-(4-фторфеніл)акрилоїл]морфолін
 Бактерициди:
 бронопол, дихлорофен, нітрапірин, нікель-диметилдитіокарбамат, касугаміцин, октилінон, фуранкарбонова
 кислота, окситетрациклін, пробеназол, стрептоміцин, теклофалам, сульфат міді та інші сполуки, що містять мідь
 Інсектициди/Акарициди/Нематоциди:
 абамектин, ацефати ацетаміпрід, акринатрин, аланікарб, алдикарб, алдоксикарб, альфа-циперметрин,
 альфаметрин, амітраз, авермектин, AZ 60541, азадирахтин, азаметифос азінфос А, азінфос М, азоциклотин,
 Bacillus popilliae, Bacillus sphaencus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Baculo віруси, Beauvena
 bassiana Beauvena tenella, бендіокарб, бенфуракарб, бенсультап, бензоксимати, бетацифлутрин, біфеназати,
 біфентрин, біоетанометрин, бюперметрин, бістрифлурон, ВРМС, бромфос А, буфенкарб, бупрофецин,
 бутатіофос, бутокарбоксим, бутилпіридабен,
 кадусафос, карбарил, карбофуран, карбофенотіон, карбосульфат, картап, хлоетокарб, хлоретоксифос,
 хлорфенапір, хлорфенвінфос, хлофлуазурон, хлормефос, хлорпірифос, хлорпірифос М, хловапортрин,
 хромафенозиди, цис-резметрин, цисперметрин, клоцитрин, клоетокарб, клофентезини, клотіанідини, ціанофос,
 циклопрени, циклопротрин, цифлутрин, цигалотрин, цигексатин, циперметрин, циромацизи,
 дельтаметрин, деметон М, деметон S, деметон-S-метил, діафентіурон, діацинон, дихлорвос, дикофол,
 дифлубензурон, диметоат, диметилвінфос, діофенолан, дисульфотон, докузат-натрій, дофенапін,
 ефлузиланати, емаектин, емпентрин, ендосульфат, Entomorphthora spp., есфенвалерати, етіофенкарб, етіон,
 етопрофос, етофенпрокс, етоксазоли, етримфос,

фенаміфос, феназаквін, фенбутатин оксид, фенітротіон, фенотіокарб, феноксакрим, феноксикарб, фенпропатрин, фенпірад, фенпіритрин, фенпіроксимати, фенвалерати, фіпроніл, флуазурон, флуброцитринати, флуциклоксурон, флуцитринати, флуфеноксурон, флуметрин, флутензини, флувалінати, фонофос, фосметилан, фостіазати, фубфенпрокс, фураціокарб,

гранулоподібні віруси,
галофенозиди, HCH, гептенофос, гексафлумурон, гексилтіазокс, гідропрени,
імідаклоприд, індоксакарб, ізазофос, ізофенфос, ізоксатіон, івермектин,
віруси поліедроза, ламбда-цигалотрин, луфенурон,

малатіон, мекарбам, метальдегід, метамідофос, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, метидатіон, метіокарб, метопрени, метоміл, метоксифенозиди, метолкарб, метоксadiaзони, мевінфос, мілбемектин, мілбеміцин, монокротофос,

налед, нитенпірам, нитіазини, новалурон, ометоат, оксаміл, оксидеметон М,

Raecilomycetes fumosoroseus, паратіон А, паратіон М, перметрин, фентоат, форат, фозалони, фозмет, фосфамідон, фоксим, піримікарб, піриміфос А, піриміфос М, профенофос, промекарб, пропаргіти, пропоксур, протіофос, протоат, піметрозини, піраклофос, пірезметрин, піретрум, піридабен, піридатіон, піримідифен, піріпроксифен, хіналфос, рибавірин,

салитіон, себуфос, силафлуофен, спіносад, спіродиклофен, сульфотеп, сульпрофос,

тау-флувалінати, тебуфенозиди, тебуфенпірад, тебупіриміфос, тефлубензулон, тефлутрин, темефос, темівінфос, тербуфос, тетрахлорвінфос, тетрадифон тета-циперметрин, тіаклоприд, тіаметоксам, тіапроніл, тіатрифос, тіоциклам гідрооксалати, тіодикарб, тіофанокс, турингіенсин, тралоцитрин, тралометрин, триаратени, триазамати, триазофос, триазурон, трихлорфенідини, трихлорфон, трифлумурон, триметаккарб,

вамідотіон, ваніліпроли, Verticillium iecanii,

YI 5302, зета-циперметрин, золапрофос,

(1R-цис)-[5-(фенілметил)-3-фураніл]метил-3-[(дигідро-2-оксо-3(2H)-фураніліден)-метил]-2,2-диметилциклопропанкарбоксилат,

(3-феноксифеніл)метил-2,2,3,3-тетраметилциклопропанкарбоксилат,

1-[(2-хлор-5-тіазоліл)метил]тетрагідро-3,5-диметил-N-нітро-1,3,5-триазин-2(1H)-імін,

2-(2-хлор-6-фторфеніл)-4-[4-(1,1-диметилетил)феніл]-4,4-дигідрооксазол,

2-(ацетилокси)-3-додецил-1,4-нафталіндіон,

2-хлор-N-[[[4-(1-фенілетокси)феніл]аміно]карбоніл]бензамід,

2-хлор-N-[[[4-(2,2-дихлор-1,1-дифторетокси)феніл]аміно]карбоніл]бензамід,

3-метилфенілпропілкарбамат,

4-[4-(4-етоксифеніл)-4-метилпентил]-1-фтор-2-феноксibenзол,

4-хлор-2-(1,1-диметилетил)-5-[[2-(2,6-диметил-4-феноксифеноксид)етил]тіо]-3(2H)піридазинон,

4-хлор-2-(2-хлор-2-метилпропіл)-5-[(6-йод-3-піридиніл)метокси]-3(2H)піридазинон,

4-хлор-5-[(6-хлор-3-піридиніл)метокси]-2-(3,4-дихлорфеніл)-3(2H)піридазинон,

Bacillus thuringiensis лінія EG-2348,

[2-бензоіл-1-(1,1-диметилетил)]гідразид бензойної кислоти,

2,2-диметил-3-(2,4-дихлорфеніл)-2-оксо-1-оксаспіро[4,5]дец-3-ен-4-іловий естер бутанової кислоти,

[3-[(6-хлор-3-піридиніл)метил]-2-тіазолідиніліден]ціанамід,

дигідро-2-(нітрометил)-2H-1,3-тіазин-3(4H)-карбоксальдегід,

етил [2-[[1,6-дигідро-6-оксо-1-(фенілметил)-4-піридазиніл]окси]етилкарбамат,

N-(3,4,4-трифтор-1-оксо-3-бутеніл)гліцин,

N-(4-хлорфеніл)-3-[4-(дифторметокси)феніл]-4,5-дигідро-4-феніл-1H-піразол-1-карбоксамід,

N-[(2-хлор-5-тіазоліл)метил]-N'-метил-N"-нітрогуанідин,

N-метил-N'-(1-метил-2-пропеніл)-1,2-гідразиндикарботіоамід,

N-метил-N'-2-пропеніл-1,2-гідразиндикарботіоамід,

O,O-діетил[2-(дипропіламіно)-2-оксоетил]етилфосфорамідотіоат,

N-ціанометил-4-трифторметилнікотинамід,

3,5-дихлор-1-(3,3-дихлор-2-пропенілокси)-4-[3-(5-трифторметилпіридин-2-ілокси)-пропокси]бензол.

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

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

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

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

Як вже було зазначено вище, згідно з винаходом можуть бути оброблені всі рослини та їх частини. У переважній формі виконання винаходу обробляють дикоростучі рослини або види та сорти рослин, а також їх частини, одержані звичайними методами біологічного розведення, наприклад, схрещуванням або злиттям протопластів.

В іншій переважній формі виконання обробляють трансгенні рослини та сорти рослин, одержані генно-технологічними методами, в разі необхідності, у комбінації зі звичайними методами (генетично модифіковані організми), та їх частини. Поняття "частини" або "частини рослин" або "органи рослин" було пояснене вище.

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

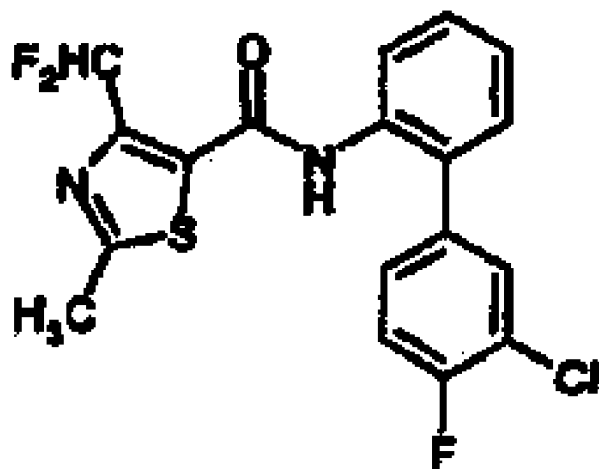
В залежності від виду або сорту рослин, їх походження та умов росту (ґрунт, клімат, період вегетації, харчування) в результаті обробки згідно з винаходом можуть спостерігатися нададитивні ("синергічні") ефекти. Так, наприклад, можливе зниження кількості застосовуваних речовин та/або розширення спектру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

До переважних трансгенних (отриманих з використанням генних технологій) рослин або сортів рослин, що підлягають обробці, згідно з винаходом належать всі рослини, які містять генетичний матеріал, модифікований за генною технологією, що додає цим рослинам особливо вигідних цінних властивостей. Прикладами таких властивостей є кращий ріст рослин, підвищена толерантність по відношенню до високих або низьких температур, підвищена толерантність до браку вологи або до вмісту солей у воді або у ґрунті, підвищена продуктивність при цвітінні, полегшення збору врожаю, прискорення дозрівання, більш високий врожай, більш висока якість та/або більш висока поживність продуктів врожаю, більша тривалість збереження та/або краща перероблюваність продуктів врожаю. До інших та особливо переважних прикладів таких властивостей належать підвищена стійкість рослин до тваринних шкідників та до мікроорганізмів, таких як комахи, кліщі, патогенні для рослин грибки, бактерії та/або віруси, а також підвищена толерантність рослин до певних гербіцидних активних речовин. Як приклади трансгенних рослин слід згадати важливі культурні рослини, такі як зернові (пшениця, рис), кукурудза, соя, картопля, бавовна, рапс, а також фруктові рослини (із плодами яблук, груш, плодами цитрусових та винограду), причому особливу перевагу надають кукурудзі, сої, картоплі, бавовні та рапсу. До особливо переважних властивостей належать підвищення стійкості рослин до комах завдяки токсинам, що утворюються в рослинах, особливо таким, які створюються за допомогою генетичного матеріалу з *Bacillus Thuringiensis* (наприклад, за допомогою генів CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb та CryIF, а також їх комбінацій) у рослинах (надалі "Бт рослини"). До особливо переважних властивостей належать також підвищення стійкості рослин по відношенню до грибків, бактерій та вірусів завдяки набутій системній стійкості (SAR), системіну, фітоалексину, еліциторам, а також генам резистентності та відповідно експримованим протеїнам та токсинам. Крім того до особливо переважних властивостей належать також підвищення толерантності рослин по відношенню до певних гербіцидно активних речовин, наприклад, імідазолінів, сульфонілкарбамідів, гліфозатів або фосфінотрицину (наприклад, "PAT"-ген). Гени, що забезпечують бажані властивості, можуть зустрічатися в трансгенних рослинах в комбінаціях між собою. Прикладами "Бт. рослин" є сорти кукурудзи, бавовни, сої та картоплі, наявні у продажу під торговельними марками YIELD GARD® (наприклад, кукурудза, бавовна, соя), KnockOut® (наприклад, кукурудза), StarLink® (наприклад, кукурудза), Bollgard® (бавовна), NucleoTn® (бавовна) та NewLeaf® (картопля). Прикладами толерантних до гербіцидів рослин є сорти кукурудзи, сорти бавовни та сорти сої, наявні у продажу під торговельними марками Roundup Ready® (толерантність по відношенню до гліфозату, наприклад, кукурудза, бавовна, соя), Liberty Link® (толерантність по відношенню до фосфінотрицину, наприклад, рапс), IMI® (толерантність по відношенню до імідазолінів) та STS® (толерантність по відношенню до сульфонілкарбамідів, кукурудза). Стійкими до гербіцидів (звичайно вирощені в умовах толерантності по відношенню до гербіцидів) рослинами є наявні у продажу під назвою Clearfield® сорти рослин (наприклад, кукурудза). Зрозуміло, що ці висловлення справедливі і для сортів рослин, що будуть одержані в майбутньому або які в майбутньому потраплять на ринок, з цими або в майбутньому створеними генетичними властивостями.

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

Приклади одержання

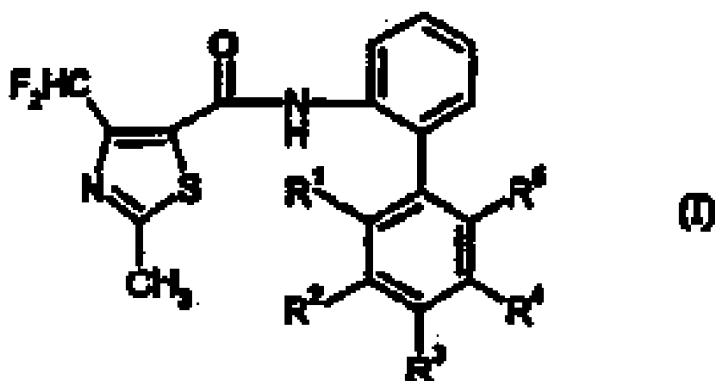
Приклад 1



Спосіб а)
0,288г (1,3ммоль) 3'-хлор-4'-фтор-1,1'-біфеніл-2-аміну та 0,33г (1,5ммоль) 2-метил-4-(дифторметил)-1,3-тіазол-5-карбонілхлориду розчиняють у 6мл тетрагідрофурану та додають 0,36мл (2,6ммоль) триетиламіну. Реакційний розчин перемішують протягом 16 годин при температурі 60 °С. Для подальшої обробки розчин концентрують та піддають хроматографії на силікагелі з використанням суміші циклогексан/етиловий естер оцтової кислоти.

Одержують 0,434г (84% від теор.) N-(3'-хлор-4'-фтор-1,1'-біфеніл-2-іл)-2-метил-4-(дифторметил)-1,3-тіазол-5-карбоксаміду з показником $\log P$ (рН2,3)=3,28.

Аналогічно до прикладу 1, а також відповідно до інформації в загальному описі здійснення способів а) та б) одержують наведені нижче в таблиці сполуки формули (I).

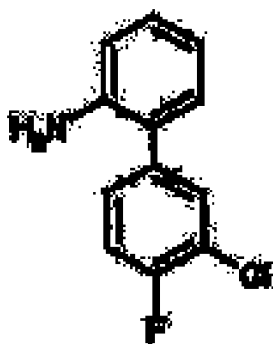


Таблиця 1

Прим.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	logP
2	H	H	H	H	H	1,27
3	H	H	CH ₃	H	H	1,53
4	H	Cl	H	H	H	1,39
5	H	H	OCF ₃	H	H	3,72
6	H	H	OCF ₃	H	H	3,40
7	H	H	F	H	H	3,08
8	H	Cl	Cl	H	H	2,54
9	Cl	H	Cl	H	H	2,58
10	CH ₃	H	Cl	H	H	3,77
11	H	F	Cl	H	H	2,29
12	H	Cl	CH ₃	H	H	1,62
13	H	H	Cl	H	H	1,38
14	H	F	H	Cl	H	2,08
15	F	H	H	H	H	3,34
16	H	CH ₃	Cl	H	H	3,68
17	H	Cl	H	Cl	H	3,7
18	H	F	H	F	H	3,07
19	H	CH ₃	Cl	H	H	3,68
20	H	F	F	H	H	3,04
21	H	H	Cl	H	H	3,27
22	H	F	H	H	H	3,58
23	H	F	CH ₃	H	H	3,43
24	F	H	F	H	H	3,08
25	H	H	CH ₃	H	H	2,31
26	H	H	H	H	H	3,50

Синтезний ланцюг 4-хлор-3-фтор-2-йоданіліну (II)

Приміт (II-1)



38,8г (223ммоль) 3-хлор-4-фторфенілборної кислоти, 40,6г (186ммоль) 2-йоданіліну розчиняють в 220мл толуолу, 22мл етанолу та 45мл 4М розчину гідрокарбонату натрію в атмосфері аргону. Додають 4,3г (4ммоль) тетракіс(трифеніл-фосфін)паладію(0), реакційний розчин протягом 16 годин перемішують при температурі 80°C в атмосфері аргону. Органічну фазу відділяють, висушують над сульфатом магнію та концентрують. Залишок піддають хроматографії на силікагелі з використанням суміші циклогексан/етиловий естер оцтової кислоти.

Одержують 22,5г (48% від теор.) 3'-хлор-4'-фтор-1,1'-біфеніл-2-аміну (чистота 88%) з показником logP (pH2,3)=3,01.

Визначення вказаних у таблицях та прикладах одержання значень logP відбувається згідно з [Директивою ЄЕС 79/831 Додаток V.A8] за допомогою HPLC (High Performance Liquid Chromatography - вискоєфективної рідинної хроматографії) на колонці з оберненою фазою (C 18). Температура: 43°C.

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

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

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

Приклади застосування

Приклад А

Дослідження Venturia (на яблунах)/захист

Розчинник: 24,5ваг. частин ацетону, 24,5ваг. частин диметилацетаміду,

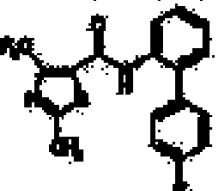
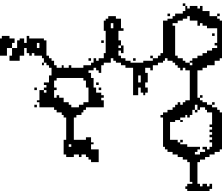
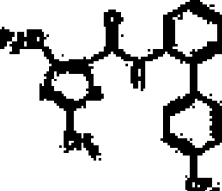
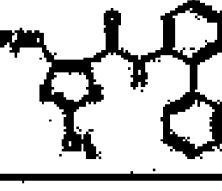
Емульгатор: 1,0ваг. частина алкіларилполігліколевого етеру.

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

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

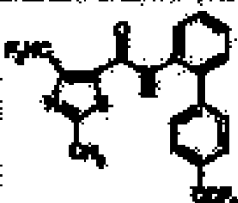
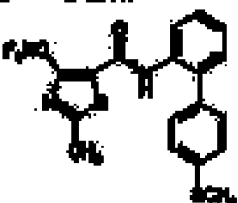
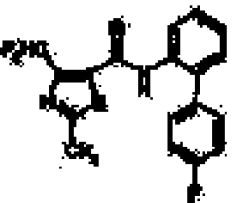
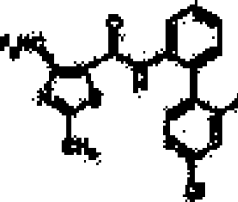
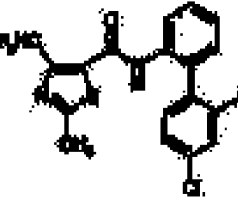
Після цього рослини поміщають в теплицю при температурі приблизно 21°C та відносній вологості повітря 90%.

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

Таблиця 2			
Дослідження Venturia (на яблунах) /захист			
Прим.	Активна речовина	Концентрація розчину, мг/л, в 20% розчині, pH2,3, в 20% ацетонітрилі	% ефекту
Результат: 80-100% захист			
1		10	10
Результат: 30% захист			
2		10	100
3		10	100
4		10	100

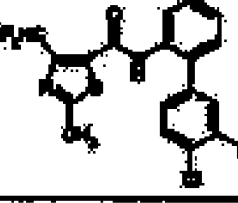
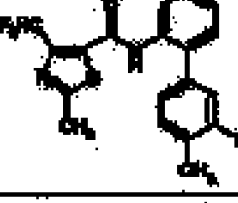
Таблиця А:

Дослідження Botrytis (на бобових) / захист

Прим.	Хімічна речовина	Концентрація речовини, г/л в тілі	% ураження дф
5			
10		10	87
15		10	92
20			
25		10	100
30		10	98
35			
40		10	100

Таблиця Б:

Дослідження Botrytis (на бобових) / захист

Прим.	Хімічна речовина	Концентрація речовини, г/л в тілі	% ураження дф
45			
50		10	100
55			
60		10	100

Приклад В

Дослідження Botrytis (на бобових)/захист

Розчинник: 24,5ваг. частин ацетону, 24,5ваг. частин диметилацетаміду,
Емульгатор: 1,0ваг. частина алкіларилполігліколевого етеру.

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

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

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

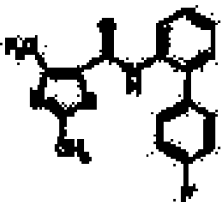
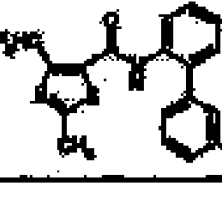
Таблиця 12:			
Додатковий шматочок для визначення концентрації			
Плям.	Активна речовина	Концентрація, мг/л розчину, р-ч. в г/л	% ураження дії
Речовина 1: 0,5-1,0%			
3-7		100	50
Різна концентрація			
1		100	100
3		100	100
4		100	100

Таблица 11

Исследование флуоресценции (по методу) / минута

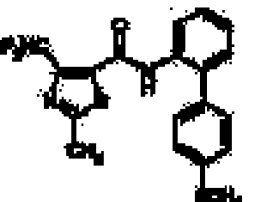
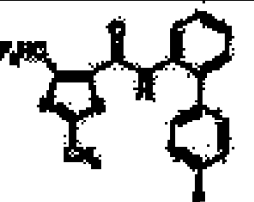
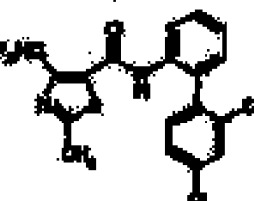
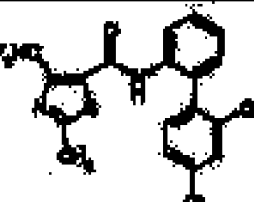
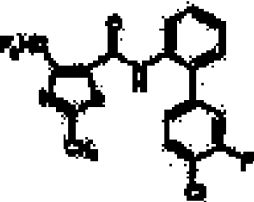
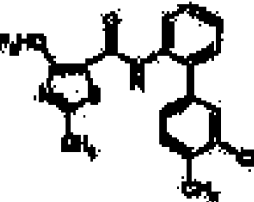
Экземпляр	Активная дробь	Исходная концентрация раствора, г/мл	% флуоресценции
3		100	95
6		100	94
7		100	94
9		100	95
10		100	100

Таблица 12

Исследование флуоресценции (по методу) / минута

Экземпляр	Активная дробь	Исходная концентрация раствора, г/мл	% флуоресценции
11		100	104
12		100	100

Приклад С

Дослідження in vitro для визначення ED₅₀ у мікроорганізмів

В порожнини мікротитрувальних пластин по краплях додають метанольний розчин активної речовини з емульгатором PS16. Після цього розчинник випаровують, в кожну порожнину додають по 200мкл середовища картопляної декстрази.

Попередньо середовище насичують відповідною концентрацією спор або міцелію досліджуваного гриба.

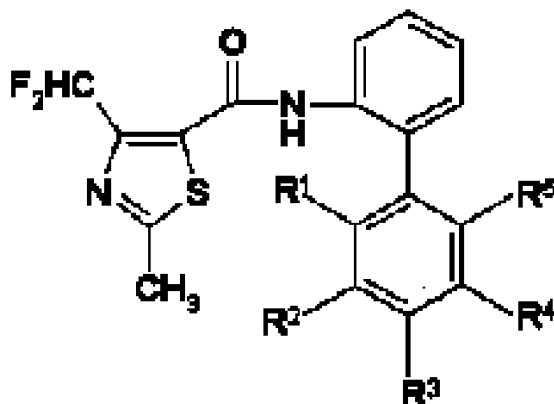
Кінцеві концентрації активної речовини становлять 0,1, 1, 10 та 100м.ч. Кінцеві концентрації емульгатора становлять 300м.ч.

Після цього пластини інкубують протягом 3-5 днів в апараті для струшування при температурі 22 °С, доки на необроблених зразках не спостерігатиметься достатній ріст.

Оцінювання відбувається фотометричним способом при довжині хвилі 620нм. На основі застосування різних концентрацій підраховують дозу активної речовини, яка приводить до 50%-ного інгібування росту грибів по відношенню до необроблених контрольних зразків (ED₅₀).

Формула винаходу

1. Дифторметилтіазолілкарбоксаніліди формули (I)
, (I)



в якій

R¹ означає водень, галоген або C₁-C₆-алкіл,

R² означає водень, галоген, C₁-C₆-алкіл або C₁-C₄-галогеналкіл,

R³ означає водень, галоген, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-галогеналкокси або C₁-C₄-галогеналкілтію,

R⁴ означає водень або галоген,

R⁵ означає водень.

2. Дифторметилтіазолілкарбоксаніліди формули (I) за п. 1, в якій

R¹ означає водень, хлор, фтор або метил,

R² означає водень, хлор, метил або трифторметил,

R³ означає водень, фтор, хлор, бром, трифторметил, трифторметокси або трифторметилтію,

R⁴ означає водень, хлор або фтор,

R⁵ означає водень.

3. Дифторметилтіазолілкарбоксаніліди формули (I) за п. 1, в якій

R¹, R², R⁴ та R⁵ відповідно означають водень та

R³ має вказані в п. 1 значення.

4. Дифторметилтіазолілкарбоксаніліди формули (I) за п. 1, в якій

R¹, R², R⁴ та R⁵ відповідно означають водень та

R³ означає фтор, хлор, бром, метил, трифторметил, трифторметокси або трифторметилтію.

5. Дифторметилтіазолілкарбоксаніліди формули (I) за п. 1, в якій

R², R⁴ та R⁵ відповідно означають водень та

R¹ та R³ мають вказані в п. 1 значення.

6. Дифторметилтіазолілкарбоксаніліди формули (I) за п. 1, в якій

R², R⁴ та R⁵ відповідно означають водень та

R¹ та R³ незалежно один від одного означають фтор, хлор або метил.

7. Дифторметилтіазолілкарбоксаніліди формули (I) за п. 1, в якій

R¹, R⁴ та R⁵ відповідно означають водень та

R² та R³ мають вказані в п. 1 значення.

8. Дифторметилтіазолілкарбоксаніліди формули (I) за п. 1, в якій

R¹, R⁴ та R⁵ відповідно означають водень та

R² та R³ означають фтор, хлор, метил або трифторметил.

9. Дифторметилтіазолілкарбоксаніліди формули (I) за п. 1, в якій

R^1 , R^3 та R^5 відповідно означають водень та

R^2 та R^4 мають вказані в п. 1 значення.

5 10. Дифторметилтіазолілкарбоксаніліди формули (I) за п. 1, в якій

R^1 , R^3 та R^5 відповідно означають водень та

R^2 та R^4 означають фтор, хлор або метил.

10 11. Засіб для боротьби з небажаними мікроорганізмами, який відрізняється тим, що він містить щонайменше один дифторметилтіазолілкарбоксанілід формули (I) за п. 1 поряд з розріджувачами та/або

поверхнево-активними речовинами.

12. Спосіб боротьби з небажаними мікроорганізмами, який відрізняється тим, що дифторметилтіазолілкарбоксаніліди формули (I) за п. 1 наносять на мікроорганізми та/або їх життєвий простір.

15

20

25

30

35

40

45

50

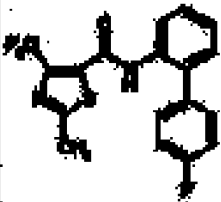
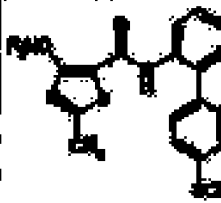
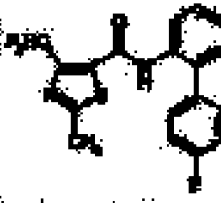
55

60

65

U A 7 9 2 6 6 C 2

U A 7 9 2 6 6 C 2

Таблиця 5			
Детектування in vitro для наявності ED ₅₀ у мікропрепаратах			
Препарат	Хімічна речовина	мікропрепарат	ED ₅₀ - мікрограм
Таблиця 5П-5.2.4.1.202			
3.37		Хімічна речовина Депозитний зразок	>100 64,34
Таблиця 4 мікропрепарат			
3		Хімічна речовина Депозитний зразок	<0,1 0,04
4		Хімічна речовина Депозитний зразок	<0,1 0,03
5		Хімічна речовина Депозитний зразок	<0,1 0,05
Таблиця 6:			
Детектування in vitro для наявності ED ₅₀ мікропрепаратах			
Препарат	Хімічна речовина	мікропрепарат	ED ₅₀ - мікрограм
6		Хімічна речовина Депозитний зразок	1,25 1,33
7		Хімічна речовина Депозитний зразок	0,04 0,08

Офіційний бюлетень "Промислова власність". Книга 1 "Винаходи, корисні моделі, топографії інтегральних мікросхем", 2007, N 8, 11.06.2007. Державний департамент інтелектуальної власності Міністерства освіти і науки України.