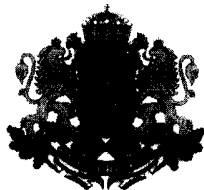


РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ



(19) BG

ЗАЯВКА ЗА ПАТЕНТ

ЗА

ИЗОБРЕТЕНИЕ

(11) 100759A

(51) A01N 43/82

C07D285/01

C07D417/06

ПАТЕНТНО ВЕДОМСТВО

(21) Заявителски № 100759			(71) Заявител(и):
(22) Заявено на 31.07.1996			BAYER AKTIENGESellschaft, ., D-51368 LEVERKUSEN, . (DE);
(24) Начало на действие на патента от:			(72) Изобретател(и):
Приоритетни данни			UHR, HERMANN ., KREFELD (DE); KUNISCH, FRANZ ., ODENTHAL (DE); WACHTLER, PETER ., KOELN (DE); KUGLER, MARTIN ., LEICHLINGEN (DE); MITTENDORF, Joachim ., D 42113 Wuppertal (DE);
(31)	4403838	(32) 08.02.1994 (33) DE	(74) Представител по индустриална собственост:
(41) Публикувана заявка в бюлетин № 4 30.04.1997			Георги Цветанов Перев, 1124 София, ул. "Леонардо да Винчи" 3
(45) Отпечатано на			
(46) Публикувано в бюлетин № на			
(56) Информационни източници:			
(62) Разделена заявка от рег. №			(86) № на PCT заявка:
			PCT/ EP95/0 / 0283, 26.01.1995
			(87) № и дата на PCT публикация:
			95/215 / 26, 17.08.1995

(54) 1,3,2-БЕНЗОДИТИАЗОЛ-1-ОКСИДНИ ПРОИЗВОДНИ

(57) Изобретението се отнася до нови и известни 1,3,2-бензодитиазол-1-оксиди с формулаи до тяхното получаване и приложение за защита на промишлени материали от увреждане, причинено от микроорганизми.

7 прете нции, 7 претенции, 0

BG 100759A

31.07.96

A-591/96-ГП

1,3,2-БЕНЗОДИТИАЗОЛ-1-ОКСИДНИ ПРОИЗВОДНИ

Изобретението се отнася до бактерицидното приложение на 1,3,2-бензодитиазол-1-оксиди, до нови 1,3,2-бензодитиазол-1-оксиди и до методи за тяхното получаване.

Известно е, че някои 1,3,2-бензодитиазол-1-оксиди във фармацевтични състави притежават антимикотично действие (виж US-A-5 140 018).

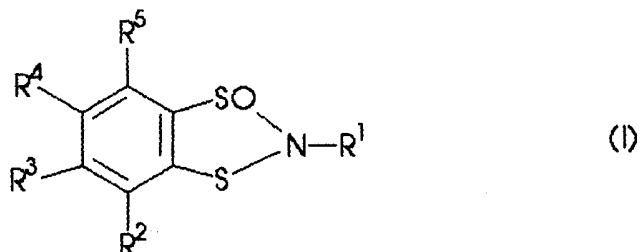
Известни са също така и структурно подобни N-алкил-бенз[1,2]изотиазол-3-они и тяхното приложение за защита на материали (виж например DE-A 4 027 378, GB 1 531 431, EP 18 100). Не винаги, обаче, активността и обхвата на действие на тези съединения е напълно задоволителна, особено при ниски концентрации. Изненадващо се оказва, че 1,3,2-бензодитиазол-1-оксидите съгласно изобретението имат не само по-широк обхват на действие, но и подчертано по-голяма активност.

Установено е, че 1,3,2-бензодитиазол-1-оксидите - някои от

31.07.98

- 2 -

които са познати - с обща формула (I)



В която

R^1 представлява водород, евентуално заместен алкил, алкокси, алкенил, алкинил, циклоалкил, арил, хетероарил или араalkил, или хетероариалкил, и

R^2 , R^3 , R^4 и R^5 , независимо един от друг представляват водород, халоген, алкил, халогеноалкил, алкокси, халогеноалкокси, алкилтио, халогеноалкилтио, диаalkиламино, нитро или циано, са подходящи като бактерициди за защита на промишлени материали.

Общата дефиниция за 1,3,2-бензотиазол-1-оксидите, които могат да бъдат използвани съгласно изобретението, се дава с формула (I). Предпочитание се отдава на съединенията с формула (I), в които

R^1 представлява водород, правоверижан или разклонен алкил, съдържащ от 1 до 18 въглеродни атома, правоверижан или разклонен алкенил, съдържащ от 2 до 18 въглеродни атома, правоверижан или разклонен алкинил, съдържащ от 2 до 18 въглеродни атома, който евентуално е заместен еднократно или многократно с еднакви или различни заместители, включващи халоген, алкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 9 еднакви или различни халогенни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 9 еднакви или различни халогенни

атома, ацил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, (алкокси)-карбонил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, амино, който евентуално е заместен с еднакви или различни заместители, включващи алкил или арил, евентуално заместен фенокси или пиридилокси, нитро или циано;

представлява циклоалкил, състоящ се от 1 до 4 свързани помежду си пръстенни системи, притежаващи от 3 до 18 въглеродни атома, който евентуално е заместен еднократно или многократно с еднакви или различни заместители, включващи халоген, алкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 5 еднакви или различни халогенни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 5 еднакви или различни халогенни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 5 еднакви или различни халогенни атома, нитро или циано;

представлява арил, който евентуално е заместен еднократно или петкратно с халоген, алкил, съдържащ от 1 до 10 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома и от 1 до 8 еднакви или различни халогенни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 10 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома и от 1 до 8 еднакви или различни халогенни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 10 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома и от 1 до 8 еднакви или различни халогенни атома, амино, моноалкиламино, съдържащ правоверижни или разклонени алкилни радикали, притежаващи от 1 до 6 въглеродни атома, гуалкиламино, съдържащ еднакви или различни, правоверижни или разклонени

алкилни радикали, всеки от които има от 1 до 6 въглеродни атома, циклоалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, метилендиокси, дифлуорометилендиокси, хлорофлуорометилендиокси, дихлоро-метилендиокси, нитро или циано;

и представлява аракил, в който алкилният радикал е правоверижен или разклонен, и който се състои от 1 до 8 въглеродни атома, и арил, който за предпочитане представлява фенил, евентуално заместен от еднократно до четирикратно с еднакви или различни заместители, включващи халоген, алкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, амино, моноалкиламино, съдържащ правоверижни или разклонени алкилни радикали, притежаващи от 1 до 6 въглеродни атома, диаалкиламино, съдържащ еднакви или различни, правоверижни или разклонени алкилни радикали, всеки от които има от 1 до 6 въглеродни атома, циклоалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, метилендиокси, дифлуорометилендиокси, хлорофлуорометилендиокси, дихлоро-метилендиокси, нитро или циано,

R^2 , R^3 , R^4 и R^5 , независимо един от друг представляват водород, халоген, алкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкилтио,

съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, гуакуламино, съдържащ еднакви или различни, правоверижни или разклонени алкилни радикали, всеки от които има от 1 до 6 въглеродни атома, нитро или циано.

Особено предпочитание се отдава на съединенията с формула (I), в които

R^1 представлява водород, правовериден или разклонен алкил, съдържащ от 1 до 14 въглеродни атома, правовериден или разклонен алкенил, съдържащ от 2 до 14 въглеродни атома или правовериден или разклонен алкинил, съдържащ от 2 до 14 въглеродни атома, който евентуално е заместен от еднократно до четирикратно с еднакви или различни заместители, включващи флуор, хлор, алкокси, съдържащ от 1 до 5 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 5 въглеродни атома и от 1 до 5 флуорни и/или хлорни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 5 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 5 въглеродни атома и от 1 до 5 флуорни и/или хлорни атома, ацил, съдържащ от 1 до 5 въглеродни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 5 въглеродни атома, алкоксикарбонил, съдържащ 1 до 5 въглеродни атома, амино, който евентуално е заместен с еднакви или различни заместители, включващи алкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и/или фенил, фенокси или пиридилокси, нитро или циано; представлява циклоалкил, състоящ се от 1 до 3 пръстенни системи, притежаващи от 3 до 14 въглеродни атома, който евентуално е заместен от еднократно до четирикратно с еднакви или различни заместители, включващи флуор/хлор, алкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, нитро или циано; представлява арил, който евентуално е заместен от еднократно

до четирикратно с флуор, хлор, алкил, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 флуорни и/или хлорни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 флуорни и/или хлорни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 флуорни и/или хлорни атома, амино, моноалкиламино, съдържащ алкилни радикали, притежаващи от 1 до 4 въглеродни атома, гуалкиламино, съдържащ еднакви или различни, правоверижни или разклонени алкилни радикали, всеки от които има от 1 до 4 въглеродни атома, циклоалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, метилендиокси, дифлуорометилендиокси, хлорофлуорометилендиокси, дихлорометилендиокси, нитро или циано;

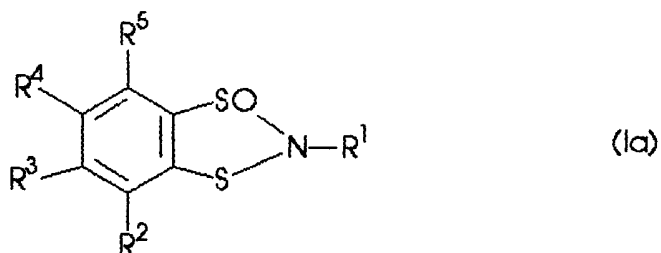
представлява аралкил, в който алкилният радикал е правовериден или разклонен и който се състои от 1 до 8 въглеродни атома, и арил, който за предпочитане представлява фенил, евентуално заместен от еднократно до четирикратно с флуор, хлор, алкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 4 флуорни и/или хлорни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 4 флуорни и/или хлорни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 4 флуорни и/или хлорни атома, амино, моноалкиламино, съдържащ алкилни радикали, притежаващи от 1 до 4 въглеродни атома, гуалкиламино, съдържащ еднакви или различни алкилни радикали, всеки от които има от 1 до 4 въглеродни атома, циклоалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, метилендиокси, дифлуорометилендиокси, хлорофлуорометилендиокси, дихлоро-

метилендиокси, нитро или циано;

R^2 , R^3 , R^4 и R^5 , независимо един от друг представляват водород, хлор, флуор, алкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 6 флуорни и/или хлорни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 6 флуорни и/или хлорни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 6 флуорни и/или хлорни атома, диалкиламино, съдържащ еднакви или различни, правоверижни или разклонени алкилни радикали, всеки от които има от 1 до 6 въглеродни атома, нитро или циано.

1,3,2-бензодитиазолните-1-оксиди с формула (I), които могат да бъдат използвани съгласно с изобретението, в някои случаи са познати (US-A 5 140 018) и могат да бъдат получени по съответните методи.

Нови 1,3,2-бензодитиазол-1-оксиди са тези съединения с формула (Ia)



В които R^1 представлява водород, правовериден или разклонен алкил, съдържащ от 13 до 18 въглеродни атома, правовериден или разклонен алкенил или алкинил, съдържащ от 17 до 18 въглеродни атома, и представлява правовериден или разклонен алкил, съдържащ от 1 до 18 въглеродни атома, който евентуално е заместен еднократно или многократно с еднакви или различни заместители, включващи халоген, алкокси, съдържащ от 1 до 6

Въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 9 еднакви или различни халогенни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 9 еднакви или различни халогенни атома, ацил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, амино, който евентуално е заместен с еднакви или различни заместители, включващи алкил или арил, евентуално заместен фенокси или пиридилокси, нитро или циано;

представлява правоверижан или разклонен алкенил или алкинил, съдържащ от 1 до 18 въглеродни атома, който евентуално е заместен еднократно или многократно с халоген, алкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 9 еднакви или различни халогенни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 9 еднакви или различни халогенни атома, ацил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, ацилокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, (алкокси)-карбонил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, амино, който евентуално е заместен с еднакви или различни заместители, включващи алкил или арил, евентуално заместен фенокси или пиридилокси, нитро и циано;

представлява циклоалкил, състоящ се от 1 до 4 свързани помежду си пръстенни системи, притежаващи от 3 до 18 въглеродни атома, който евентуално е заместен еднократно или многократно с еднакви или различни заместители, включващи халоген, алкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 5 еднакви или различни халогенни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 5 еднакви или различни халогенни атома, алкилтио, съдържащ от 1

до 4 въглеродни атома, халогеноалкилно, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 5 еднакви или различни халогенни атома, нитро или циано;

представлява арил, който евентуално е заместен от еднократно до петкратно с алкил, съдържащ от 5 до 10 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 5 до 8 въглеродни атома и от 1 до 8 еднакви или различни халогенни атома, алкокси, съдържащ от 5 до 10 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома и от 1 до 8 еднакви или различни халогенни атома, алкилно, съдържащ от 1 до 10 въглеродни атома, халогеноалкилно, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома и от 1 до 8 еднакви или различни халогенни атома, амино, моноалкиламино и правоверижни или разклонени алкилни радикали, притежаващи от 1 до 6 въглеродни атома, циклоалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, метилендиокси, дифлуорометилендиокси, хлорофлуорометилендиокси, дихлорометилендиокси, нитро или циано;

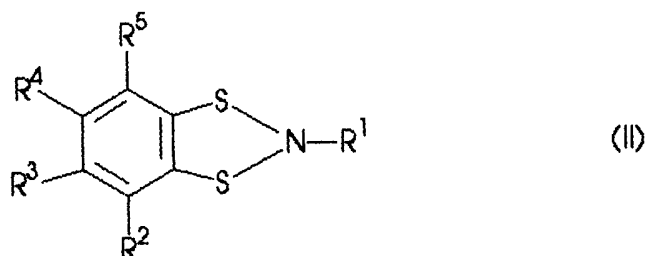
представлява аракил, в който алкилният радикал е правовериден или разклонен и се състои от 5 до 8 въглеродни атома, и арил, който за предпочитане представлява фенил, евентуално заместен еднократно или четирикратно с еднакви или различни заместители, включващи, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, алкилно, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкилно, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, амино, моноалкиламино, съдържащ правоверижни или разклонени алкилни радикали, притежаващи от 1 до 6 въглеродни атома, циклоалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, метилендиокси, дифлуорометилендиокси, хлорофлуорометилендиокси, дихлорометилендиокси, нитро или циано;

R^2 , R^3 , R^4 и R^5 , независимо един от друг представляват водород,

халоген, алкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогено-алкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, и халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, гуакиламино, съдържащ еднакви или различни, правоверижни или разклонени алкилни радикали, всеки от които има от 1 до 6 въглеродни атома, нитро или циано.

Известните и новите 1,3,2-бензодитиазол-1-оксиди с обща формула I, в която

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 и R^5 имат дадените по-горе значения, са получени като съединения с обща формула (II)



в която R^1 , R^2 , R^3 , R^4 и R^5 имат дадените по-горе значения, взаимодействат по съответните методи (виж US-A 5 140 018) с окислител и по-специално в присъствието на разреждатели.

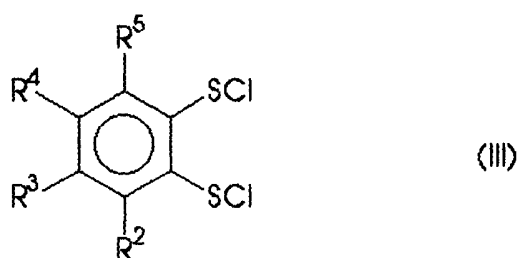
Съединенията с обща формула (II) показват също и биологични действия и са подходящи за използване като бактерициди за защита на промишлени материали.

За окислението могат да се използват всичките обичайни окислителни; тук могат да бъдат споменати например органичните пероксиди, като *m*-хлорпербензоена киселина (mCPBA) или магнезиева сол хексахидрат на монопероксифталовата киселина (MMPP) или органичните окислителни, например пиридинхлоро-

хромат (PCC), пиридин-SO₃, пиридиндихромат (PDC) или t-бутил-хипохлорид, но също и меките неорганични окислители като H₂O₂, натриев йодат, натриев перборат или оксониевомагнезиев диоксид.

Реакционните температури могат да варират в относително широки температурни граници. Реакцията обикновено се провежда в интервала между -30°C и +100°C, за предпочитане - между -10°C и +60°C. Добре е процесите да се извършват в присъствие на разреждатели. Подходящи разреждатели са водата и органичните разтворители, които също се атакуват от окислителите. Тези разтворители включват с предпочитане въглеводороди, като толуол, ксилол или хексан, хлорирани въглеводороди, като хлоробензен, хлороформ, метиленхлорид, етери, като метил t-бутилетер или нитрили, като ацетонитрил.

Известните и новите бензодитиазоли с обща формула (II), в която R¹, R², R³, R⁴ и R⁵ имат дадените по-горе значения, са получени при взаимодействие на съединения с обща формула (III)



в която R², R³, R⁴ и R⁵ имат дадените по-горе значения, по съответните методи (виж US-A 5 140 018; C.H. Chen, J. Heterocyclic Chem., 16, 183, (1979)) с амини с обща формула (IV)



в която

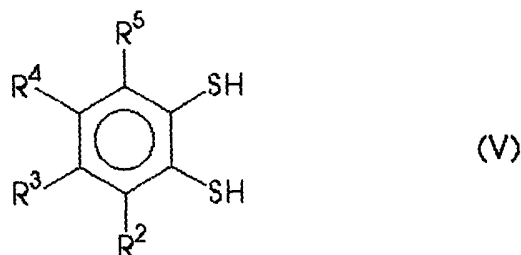
R¹ има даденото по-горе значение, в присъствието на свързващи киселината агенти, ако се изисква и, също ако се изисква, в

присъствието на разреждатели.

При този метод реакционните температури могат да варирам в относително широки температурни граници. Процесът обикновено протича в интервала между -30°C и $+100^{\circ}\text{C}$, за предпочитане - между -10°C и $+50^{\circ}\text{C}$. Добре е реакциите да се извършват в присъствие на свързващи киселината вещества, като в случая могат да се използват всичките обичайно използвани свързващи киселината агенти. Последните, за предпочитане, включват третични амини, като триетиламин и пиридин; хидроксиди на алкални метали, като натриев хидроксид и калиев хидроксид и карбонати на алкални метали и кисели карбонати на алкални метали, като калиев карбонат и кисел натриев карбонат.

Евентуално използвани подходящи разтворители са всичките инертни органични разтворители. Те включват, за предпочитане, въглеводороди, като толуен, ксилен и хексан; хлорирани въглеводороди, като хлоробензен и хлороформ; кетони, като ацетон; етери, като тетрахидрофуран, диетилетер, метил-*t*-бутилетер и диоксан; нитрили, като ацетонитрил.

Известните и новите сулфенилхлориди с обща формула III, в която R^2 , R^3 , R^4 и R^5 имат дадените по-горе значения, са получени при взаимодействие на дитиоли с формула (V)

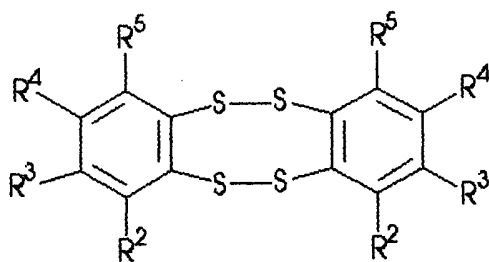


с хлорен газ в присъствието на разреждатели.

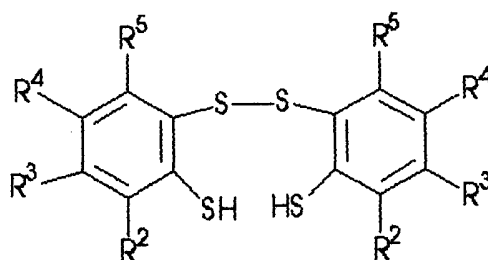
Предпочита се използването на разреждатели като

въглеродороди, например тетрачлорметан, хлороформ, метиленхлорид или 1,2-дихлороетан. Температурите могат да варират в относително широки температурни граници; процесът обикновено протича в интервала между -30°C и $+40^{\circ}\text{C}$, най-добре при температури под 20°C .

В един алтернативен метод, обаче, сулфенилхлориди могат да бъдат получени при идентични условия чрез хлориране на дисулфидни съединения с обща формула (VI) и (VII) и техните позиционни изомери (виж например E. Kuehle, *The Chemistry of the sulfenic acids*, Georg Thieme Verlag, Stuttgart 1973).

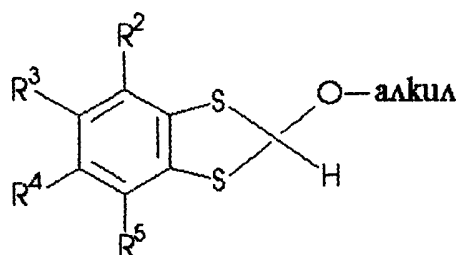


(VI)



(VII)

Друга възможност за получаването на сулфенилхлориди с обща формула (III) се състои в хлорирането на съединения с обща формула (VIII).



(VIII)

които могат да бъдат получени съгласно посочените в литературата методи (J. Nakayama, *Synthesis*, 38 (1975)).

Тиолите с формула (V) и дисулфидните съединения с формули (VI) и (VII) общо взето са известни и могат да бъдат получени по редица познати от литературата методи (виж например S. Hunig et al., *Liebigs Ann. Chem.*, 738, 192 (1979); D.M. Giolando, *Synthesis*, 451

(1992); I. Degani et al., Synthesis, 471 (1976); J.C. Marten et al., J. Am. Chem. Soc., 111, 658 (1989)).

Амините с обща формула (IV) общо взето са известни и в повечето случаи могат да бъдат доставени като търговски продукти.

Активните съединения с формули (I), (Ia) и (II) притежават силно бактерицидно действие и могат да бъдат използвани в практиката за борба с нежеланите микроорганизми. Активните съединения с формули (I), (Ia) и (II) са подходящи за защита на промишлени материали срещу атакуването и разрушаването им от нежелани микроорганизми.

Под промишлени материали в настоящия контекст трябва да се разбират материали от нежив произход, които са подготвени с оглед използването им в промишлеността. Примери за промишлени материали, които посредством активните съединения от изобретението могат да бъдат предпазвани от промени и разрушаване в резултат на микробното действие, са свързващите материали (адхезиви), лепилата, хартията, картонът, текстилните материали, кожата, гървеният материал, съставите за нанасяне на покрития и пластмасовите изделия, охлаждащите масла и други материали, които могат да попаднат под неблагоприятното въздействие на микроорганизми. В числото на защитаваните материали трябва да се споменат и обекти от производствените предприятия, например водоохладителни инсталации, които могат да бъдат увредени от размножаването на микроорганизми. Промислените материали, предпочитани за целите на настоящето изобретение, са свързващи вещества, лепила, хартия, картон, текстилни материали, кожа, гървен материал, състави за нанасяне на покрития и пластмасови изделия, охлаждащи масла и толопренасящи течности.

Примери за микроорганизми, които са в състояние да доведат до изменение или разрушаване на промишлени материали са бактериите, гъбите, дрождите, водораслите и слизестите организми. Активните съединения и/или съставите съгласно изобретението действат предпочитано срещу гъбите, по-специално плесенните, и срещу слизестите организми и водораслите.

Камо примери могат да бъдат посочени микроорганизмите от следните редове:

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

В зависимост от техните специфични физични и/или химични свойства активните съединения с формули (I), (Ia) и (II) могат да бъдат превърнати под формата на обичайните състави като разтвори, емулсии, суспензии, прахове, пени, пасты, гранули, аерозоли, и много фини капсули с обвивка от полимерни вещества.

Тези състави се получават по познатите начини, например чрез смесване на активните съединения с разреждатели, като течни разтворители, втечнени под налягане газове и/или твърди

носители, с използване евентуално на повърхностно активни вещества, като емулгатори, и/или диспергатори, и/или пенообразуватели. В случай на използване на вода като разреждател могат да се използват също, например, и добавъчни органични разтворители. Подходящи течни разтворители в повечето случаи са ароматните въглеводороди, като ксилен, толуен или алкилнафтадени, хлорирани ароматни или хлорирани алифатни въглеводороди, като хлоробензени, хлоретилен или метиленхлорид, алифатни въглеводороди, като циклохексан и парафини, например минерални маслени фракции, алкохоли, като бутанол или гликол, както и техни етери и естери, кетони, като ацетон, метилетилакетон, метилизобутилакетон или циклохексанон, силно полярни разтворители, като диметилаформамид или диметилсулфоксид, както и вода; под течни газове разреждатели се имат предвид течности, които са газообразни при стайна температура и при атмосферно налягане, например аерозолни пропеланти, като халогенирани въглеводороди, също така и бутан, пропан, азот и въглероден диоксид; като твърди носители са подходящи например естествените земни материали, като каолин, глина, талк, креда, кварц, атапулгит, монтморилонит или инфузорна пръст и синтетични земни материали, като високодисперсен силициев диоксид, диалуминиев триоксид и силикати; като твърди носители за гранули подходящи например са раздробени и фракционирани естествени скални материали, като калцит, мрамор, пемза, сепиолит и доломит, както и синтетични гранули от неорганични и органични брашна и гранули от органични материали, като гървени трици, черупки на кокосови орехи, царевични кочани, млотлоневи стъбла; като емулгатори и/или пенообразуватели например са подходящи нейонни и йонни емулгатори, като полиоксиетилен мастнокиселинни естери, полиоксиетилен мастно-

алкохолни естери, например алкиларил полиглицол етери, алкилсулфонати, алкилсулфати, арилсулфонати, както и продукти от хидролизата на белтъци; като диспергатори например са подходящи лизинсулфитните отпадни течности и метилцелулозата.

В състава на смесите могат да бъдат използвани адхезиви като карбоксиметилцелулоза и естествени и синтетични полимери под формата на прахове, латексни гранули, като гума арабика, поливинилалкохол и поливинилацетат, както и естествени фосфолипиди, като кефалини и лецитини и синтетични фосфолипиди. Под формата на други добавки могат да бъдат включени минерални и растителни масла.

Възможно е използването на оцветители, като неорганични пигменти, например железен оксид, титанов оксид и пруско синьо, и органични оцветители, както и микроколичества от подхранващи вещества, като железни соли, магнезий, бор, мед, кобалт, молибден и цинк.

Активността и спектърът на действие на активните съединения с формула (I), (Ia) и (II) и/или на съставите, изходните вещества или, най-общо, формулировките, които трябва да бъдат получени от тях, могат да бъдат увеличени, ако евентуално допълнително бъдат добавени антимикробни активни съединения, фунгициди, бактерициди, хербициди, инсектициди или други активни съединения, с цел да се разшири спектъра на действие или да се постигне определен ефект, например допълнителна защита срещу насекоми. Такива смеси могат да притежават по-широк спектър на действие в сравнение с този на съединенията от изобретението.

В редица случаи, ако това бъде направено, се постига синергичен ефект; с други думи, активността на сместа е по-

голяма от активността на отделните компоненти. Примери за това са особено благоприятните комбинации от следните компоненти:

Триазоли като:

амитрол, азоциклотин, BAS 480F, бипертанол, дифенокназол, фенбуконазол, фенхлоразол, фенетанил, флукувконазол, флузилазол, флуотриафол, имибенконазол, изозофос, миклобутанил, метконазол, епоксиконазол, паклобутразол, пенконазол, пропиокназол, ($\pm$)-*цис*-1-(4-хлорофенил)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)-циклохептанол, тетраконазол, триагумефон, триагуменол, триапентенол, трифлумизол, трипиконазол, униконазол и други метални соли и киселинни агенти.

Имидазоли като:

имазаил, нефуразоат, прохлораз, трифлумизол, 2-(1-*т*-бутил)-1-(2-хлорофенил)-3-(1,2,4-триазол-1-ил)-пропан-2-ол, триазол-карбоксанилиди като 2',6'-дибромо-2-метил-4-трифлуорометокси-4'-трифлуорометил-1,3-триазол-5-карбоксанилд, 1-имидазоил-1-(4'-хлорофенокс)-3,3-диметилбутан-2-он и техните метални соли и киселинни агенти.

Метил(E)-2-[2-[6-(2-цианофеноксипиримидин-4-илокси)фенил]-3-метоксиакрилат, метил(E)-2-[2-[6-(2-тиоамидофеноксипиримидин-4-илокси)фенил]-3-метоксиакрилат, метил(E)-2-[2-[6-(2-флуорофеноксипиримидин-4-илокси)фенил]-3-метоксиакрилат, метил(E)-2-[2-[6-(2-дифлуорофеноксипиримидин-4-илокси)фенил]-3-метоксиакрилат, метил(E)-2-[2-[3-(пиримидин-2-илокси)феноксифенил]-3-метоксиакрилат, метил(E)-2-[2-[3-(5-метилпиримидин-2-илокси)-феноксифенил]-3-метоксиакрилат, метил(E)-2-[2-[3-(фенилсулфонилокси)феноксифенил]-3-метоксиакрилат, метил(E)-2-[2-[3-(4-нитрофеноксифеноксифенил]-3-метоксиакрилат, метил(E)-2-[2-феноксифенил]-3-метоксиакрилат, метил(E)-2-[2-(3,5-диметил-

бензоил)пирол-1-ил]-3-метоксиакрилат, метил(Е)-2-[2-(3-метокси-
 фенокси)фенил]-3-метоксиакрилат, метил(Е)-2-[2-(2-фенилэтен-1-
 ил)фенил]-3-метоксиакрилат, метил(Е)-2-[2-(3,5-дихлорофенокси)-
 пирогин-3-ил]-3-метоксиакрилат, метил(Е)-2-(2-(3-(1,1,2,2-тетра-
 флуорометокси)фенокси)фенил)-3-метоксиакрилат, метил(Е)-2-(2-[3-
 (α-гидроксibenзил)фенокси]фенил)-3-метоксиакрилат, метил(Е)-2-
 (2-(4-феноксипирогин-2-илокси)-фенил)-3-метоксиакрилат,
 метил-(Е)-2-[2-(3-п-пропилоксифенокси)фенил]-3-метоксиакрилат,
 метил(Е)-2-[2-(3-изопропилоксифенокси)фенил]-3-метоксиакрилат,
 метил(Е)-2-[2-[3-(2-флуорофенокси)фенокси]фенил]-3-метокси-
 акрилат, метил-(Е)-2-[2-(3-метоксифенокси)фенил]-3-метокси-
 акрилат, метил(Е)-2-[2-(4-т-бутилпирогин-2-илокси)фенил]-3-
 метоксиакрилат, метил(Е)-2-[2-[3-(3-цианофенокси)фенокси]-
 фенил]-3-метоксиакрилат, метил-(Е)-2-[2-(3-метилпирогин-2-
 илоксиметил)фенил]-3-метоксиакрилат, метил(Е)-2-[2-[6-(2-метил-
 фенокси)пиримидин-4-илокси]фенил]-3-метоксиакрилат, метил(Е)-
 2-[2-(5-бромопирогин-2-илоксиметил)фенил]-3-метоксиакрилат,
 метил(Е)-2-[2-(3-(3-йодопирогин-2-илокси)фенокси)фенил]-3-
 метоксиакрилат, метил(Е)-2-[2-[6-(2-хлоропирогин-3-илокси)-
 пиримидин-4-илокси]фенил]-3-метоксиакрилат, (Е),(Е)метил-2-[2-
 (5,6-диметилпирозин-2-ил-метилоксиминометил)фенил]-3-метокси-
 акрилат, (Е)метил-2-[2-[6-(6-метилпирогин-2-илокси)пиримидин-4-
 илокси]фенил]-3-метоксиакрилат, (Е),(Е)метил-2-[2-(3-метокси-
 фенил)метилоксиминометил]фенил]-3-метоксиакрилат, (Е)метил-
 2-[2-(6-(2-азидофенокси)пиримидин-4-илокси]фенил]-3-метокси-
 акрилат, (Е),(Е)-метил-2-[2-[6-фенилпиримидин-4-ил)метил-
 оксиминометил]-фенил]-3-метоксиакрилат, (Е),(Е)метил-2-[2-[(4-
 хлорофенил)метилоксиминометил]фенил]-3-метоксиакрилат,
 (Е)метил-2-[2-[6-(2-п-пропилфенокси)-1,3,5-триазин-4-илокси]-
 фенил]-3-метоксиакрилат, (Е),(Е)метил-2-[2-[(3-нитрофенил)-

метилоксиминометил]фенил}-3-метоксиакрилат;

Суцинатамдехидрогеназни инхибитори като:

фенфурам, фуркарбанил, циклафлурамид, фурмециклокс, Seedvax, метсулфовакс, пирокарболоид, оксикарбоксин, ширлан, мебенил (мепронил), беноганил, флаутоланил (Moncut); нафталенови производни, като тербинафин, нафтифин, бутенафин, 3-хлоро-7-(2-аза-2,7,7-триметилокт-3-ен-5-ин);

сулфенамиди, като дихлофлуанид, толилфлуанид, фолпет, флуорфолпет, каптан, каптофол;

бензимидазоли, като карбендазим, беномил, фурапиокарб, фуберигазол, тиофонатметил, тиабендазол или техни соли;

морфолинови производни, като тригеморф, фенпропиморф, фалиморф, диметоморф, годеморф, алдиморф, фенпропидин и техни арилсулфонови киселинни соли, например р-толуенсулфонова киселина и р-годецилфенилсулфонова киселина;

гипокарбамат, куфранеб, фербам, манкопер, манкозеб, манеб, метам, метирам, тирам зенеб, зирам;

бензотиазоли, като 2-меркаптобензотиазол;

бензамиди, като 2,6-дихлоро-N-(4-трифлуорометилбензил)-бензамид;

борни съединения, като борна киселина, борни естери, боракс;

формалдехид и доставящи формалдехид съединения като бензилалкохол моно-(поли)-хемиформал, оксазолидини, хексахидро-S-триазини, N-метилолхлороацетамид, параформалдехид, нитропирин, оксолинова киселина, теклофталам;

трис-N-(циклохексилгуазендиокси)-алуминий, N-(циклохексилгуазендиокси)-трибутилкалай и калиеви соли, бис-N-(циклохексилгуазендиокси)-мед;

N-метилизотиазолин-3-он, 5-хлоро-N-метилизотиазолин-3-он, 4,5-дихлоро-N-октилизотиазолин-3-он, N-октилизотиазолин-3-он,

4,5-триметиленизотиазолинони, 4,5-бензизотиазолинони, N-метилолхлороацетамид;

алдехиди, като канелен алдехид, формалдехид, глутаралдехид, β -бромоканелен алдехид;

тиоцианати, като тиоцианатометилтиобензотиазол, метиленбисттиоцианат и др.;

кватернерни амониеви съединения, като бензилдиметилтетрагециламониев хлорид, бензилдиметилдогециламониев хлорид, дигецилдиметиламониев хлорид;

йодни производни, като гийодометил p-толилсулфон, 3-йодо-2-пропилалкохол, 4-хлорофенил-3-йодопроналформал, 3-бromo-2,3-гийодо-2-пропенилкарбамат, 2,3,3-трийодоалилалкохол, 3-бromo-2,3-гийодо-2-пропилалкохол, 3-йодо-2-пропил-п-бутилкарбамат, 3-йодо-2-пропил-п-хексилкарбамат, 3-йодо-2-пропилциклохексилкарбамат, 3-йодо-2-пропилфенилкарбамат;

фенолни производни, като трибромифенол, тетрахлорофенол, 3-метил-4-хлорофенол, 3,5-диметил-4-хлорофенол, феноксиетанол, дихлорфен, o-фенилфенол, m-фенилфенол, p-фенилфенол, 2-бензил-4-хлорофенол и техните соли с алкални и алкалоземни метали;

бактерициди с активирана халогенна група, като хлороацетамид, бронопол, брoнидокс, тектамери, като 2-бromo-2-нитро-1,3-пропандиол, 2-бromo-4'-хидрокси-ацетофенон, 2,2-дибromo-3-нитрилпропионамид, 1,2-дибromo-2,4-дицианобутан, β -бromo- β -нитростирен;

пиридини, като 1-хидрокси-2-пиридинтион (и неговите Na, Fe, Mn и Zn соли), тетрахлоро-4-метилсулфонилпиридин, пириметанол, мепанипирим, дипиритион, 1-хидрокси-4-метил-6-(2,4,4-триметилпентил)-2(1H)-пиридин;

метални соли, като меден хидроксикарбонат, натриев дихромат, калиев дихромат, калиев хромат, меден сулфат, меден

хлорид, меден борат, цинков флуоросиликат, меден флуоросиликат;
оксиди, като трибутилкалаен оксид, Cu_2O , CuO , ZnO ;

гуалкилгутиокарбамати, като Na соли и Zn соли на гуалкил-
гутиокарбамати, тетраметилтиурамов дисулфид, калиев N-
метилгутиокарбагат;

нитрили, като 2,4,5,6-тетрахлороизофталонитрил, гу-
натриев цианогитиоимидокарбагат;

хинолини, като 8-хидроксихинолин и неговите Cu соли;

мукохлорна киселина, 5-хидрокси-2(5H)-фуранон;

4,5-дихлорогитиазолинон, 4,5-бензогитиазолинон, 4,5-три-
метиленгитиазолинон, 4,5-дихлоро-(3H)-1,2-гитиол-3-он, 3,5-ди-
метилтетрахидро-1,3,5-тиагуазин-2-тион, N-(2-р-хлоробензоил-
етил)-хексаминон хлорид, калиев N-хидроксиметил-N'-метил-
гитиокарбагат;

2-оксо-2(4-хидроксифенил)ацетхидроксимов хлорид, фенол-2-
хлоро-циано-винилсулфон, фенол-1,2-дихлоро-2-циано-винилсулфон;

Ag, Zn и Cu-съдържащи цеолити - самостоятелно или
включени в полимерни активни съединения.

Особено предпочитание се отдава на смесите с:

азаконазол, бромуконазол, ципроконазол, дихлобутразол,
диниконазол, хексаконазол, метаконазол, пенконазол, пропио-
коназол, тебуконазол метил (E)-метоксимино[α -(o-толилокси)o-
толил)]ацетат, метил (E)-2-{2-[6-(2-цианофенокси)пиримидин-4-ил-
окси]фенил}3-метоксиакрилат, метфуроксам, карбоксин, фен-
никлонил, 4-(2,2-дифлуоро-1,3-бензодиоксол-4-ил)-1H-пирол-3-карбо-
нитрил, бутенафин, имазаил, N-метилизотиазолин-3-он, 5-хлоро-
N-метилизотиазолин-3-он, N-октилизотиазолин-3-он, бензизо-
тиазолинони, N-(2-хидроксипропил)-аминометанол, бензил-алкохол,
(хемил)-формал, глутаралдехид, омадин, диметилдикарбонат и/или 3-
його-2-пропил-п-бутилкарбамати.

Високоэффективни смеси са получени също така и със следните активни съединения:

Фунгициди:

ацинетакс, 2-аминобутан, ампропилфос, анилазин, беналаксил, бупиримат, хинометионат, хлоронеб, хлозолинат, цимоксанил, газомет, гикломезин, гихлорам, гуетофенкарб, гиметиримол, гуокаб, гупианон, гогин, гразоксолол, едифенфос, етиримол, етригуазол, фенаримол, фенипропан, фентин ацетат, фентин хидроксид, феримзон, флауазинам, флуормид, флусульфамид, флуотриафол, фосетил, фталид, фураалаксил, гуазатин, химексазол, ипробенфос, ипродион, изопропиолан, металаксил, метасулфокарб, нитротал-изопропил, нуаримол, офурас, оксадиил, перфлуразоат, пенцикурон, фосдифен, пимарицин, пипералин, процимидон, пропамокарб, пропинеб, пиразофос, пирифенокс, пироквиалон, квинтозен, катраново масло, текназен, тициофен, тиофанат-метил, толклофос-метил, триазоксид, трихлорамид, трициклазол, трифорин, винклозолин.

Инсектициди:

фосфорни естери, като азинфос-етил, азинфос-метил, α -1(4-хлорофенил)-4-О-етил, S-(пропил)фосфорилокси-пиразол, хлорпирифос, комафос, геметон, геметон-S-метил, гуазион, гихлорвос, гиметоат, етоат, етопрофос, етримфос, фенипропион, фентин, хептенофас, паратион, паратион-метил, фозалон, фоксим, пиримифос-етил, пиримифос-метил, профенофос, пропиофос, сулфпрофос, триазофос и трихлорфон;

карбамати, като алдикарб, бенгидокарб, α -2-(1-метилпропил)-фенил метилкарбамат, буткарбоксим, бутоксикарбоксим, карбарил, карбофуран, карбосулфан, клоетокарб, изопрокарб, метомил, оксамил, пиримикарб, промеккарб, пропоксур и тиодикарб;

органосилициеви съединения, за предпочитане диметил-

(фенил)-силилметил-3-феноксibenзилoви етери кaтo гyметил-(4-етoкcифeнил)-cилuлметил-3-фeнoкcибeнзилeтep или (гyметил-фeнил)-cилuлметил-2-фeнoкcи-6-пyригyметилoви eтepи, кaтo нaпpимep гyметил(9-етoкcифeнил)-cилuлметил-2-фeнoкcи-6-пyригyлметилeтep или [(фeнил)-3-(3-фeнoкcифeнил)пpoпил]-(гyметил)-cилaни, нaпpимep (4-етoкcифeнил)-[3-(4-флyopo-3-фeнoкcифeнил)-пpoпил]гyметилcилaн, cилaфлyoфeн;

пypeтpouгy, кaтo aлeтpин, aлфaмeтpин, бyopecмeтpин, бyфeнтpин, циклoпpoтpин, цифлyтpин, дeкaмeтpин, цихaлoтpин, ципepмeтpин, дeлтaмeтpин, α-циaнo-3-фeнил-2-мeтилбeнзил 2,2-гyметил-3-(2-хлopo-2-тpифлyopo-мeтилвинил)циклoпpoпaн-кapбoкcилaт, фeнпpoпaтpин, фeнфлyтpин, фeнвaлepaт, флyци-тpинaт, флyмeтpин, флyвaлинaт, пepмeтpин, peзмeтpин и тpлoмeтpин;

нитpомини и нитpомeтилeни, кaтo 1-[(6-хлopo-3-пyригyнил)-мeтил]-4,5-дигидpo-N-нитpo-1H-имидaзoл-2-aмин(имидaклoпpуг), N-[(6-хлopo-3-пyригyл)мeтил]-N²-циaнo-N¹-мeтилaцeтaмид (NI-25);

aбaмeктин, AC 303, 630, aцeфaт, aкpинaтpин, aлaникapб, aлдoкcикapб, aлдpин, aмипpаз, aзaмeтифoc, *Bacillus thuringiensis*, фocмeт, фocфaмидoн, фocфин, пpлeтpин, пpoпaфoc, пpoпeтaмфoc, пpoтoaт, пyрaклoфoc, пypeтpини, пyригaбeн, пyригaфeнтиoн, пyрипpoкcифeн, квинaлфoc, RH-7988, poтeнoн, нaтpиeв флyopид, нaтpиeв хeкcaфлyopocилyкaт, cyлфoтeп, cyлфopилфлyopид, кaтpaнeни мacлa, тeфлyбeнзypoн, тeфлyтpин, тeмeфoc, тepбyфoc, тeтpaxлopвинфoc, тeтpaмeтpин, O-2-т-бyтил-пyримидин-5-ил-o-изoпpoпил-фocфopoтиaт, тиoциклaм, тиoфaнoкc, тиoмeтoн, тpлoмeтpин, тpифлyoмypoн, тpимeтaкapб, вaмидoтиoн, *Verticillium laccarii*, XMC, кcилyлкapб, бeнфypaкapб, бeнcyлтaн, бифeнтpин, бyoaлeтpин, MERбyoaлeтpин, (S)-циклoпeнeтeнилoв изoмep, бpoмoфoc, бpoмoфoc-eтил, бyпpoфeзин, кaгyзaфoc, кaлциeв

полисулфид, карбофенотион, картап, хинометионат, хлорган, хлорфенвинфос, хлорфлазурон, хлормефос, хлороникрин, хлорпирифос, цианофос, β -цифлутрин, α -циперметрин, циофенотрин, циромазин, газомет, ДДТ, геметон-S-метилсулфон, гуафентиурон, гуалифос, дикротофос, дифлубензурон, диносеб, геоксабензофос, гуаксакарб, дисулфотон, DNOC, емпентрин, ендосулфан, EPN, есфенвалерат, етиофенкарб, етион, етофенпрокс, фенобукарб, феноксикарб, фенсулфотион, фипронил, флауциклоксурон, флауфенпрокс, флауфеноксурон, фонофос, форметанат, формотион, фосметилан, фуратиокарб, гептахлор, гексафлумурон, хидраметилон, хидрогенцианид, хидропрен, IPSP, изазофос, изофенфос, изопропиолан, изоксатион, йодфенфос, кадетрин, лунган, малатион, мекарбам, мефосфолан, меркурохлорид, метам, *Metarthizium anisopliae*, метакрифос, метамидофос, метигатион, метиокарб, метопрен, метоксихлор, метилизотиоцианат, метолкарб, мевинфос, монокротофос, налед, Neodiprion sertifer NPV, никотинометоат, оксигеметон-метил, пентахлорофенол, нефтени масла, фенотрин, фентоат, форат;

Молускоциди:

Фентинацетат, метаалдегид, метиокарб никлозамид, тиодикарб, триметакарб.

Алгициди:

меден сулфат, дихлорорфен, ендотал, фентинацетат, квинокламин.

Хербициди:

ацетохлор, ацифлуорфен, аклонифен, акролеин, алахлор, алоксидим, аметрин, амидосулфурон, амитрол, амониев сулфамат, анилофос, азулам атразин, азинтроптрин, беназолин, бенфлуралин, бенфурезат, бенсулфурон, бенсулфид, бентазон, бензофенкап, бензтиазурон, бифенокс, биланафос, боракс, дихлорпроп, дихлорпроп-

Р, гуклофон, гуетатил, дифеноксурон, дифензокват, дифлуфеникан, димефурон, димепиперат, диметахлор, диметаметрин, диметипин, диметиларсинова киселина, динитрамин, диносеб, диносебацетат, бромацил, бромобутид, бромифеноксим, бромоксинил, бутахлор, бутамифос, фенахлор, бутралин бутилат, карбетамид, CGA 184927, хлорметоксифен, хлорамбен, хлорбромурон, хлорбутам, хлорфуренол, хлоригазон, хлоримурон, хлорнитрофен, хлороцетна киселина, ахлоропикрин, хлоротолуон, хлороксурон, хлорпрефам, хлорсулфурон, хлортал, хлортиамид, цинметилин, циофулсурон, клетодим, кломазон, кломенпроп, клопиралид, цианамид, цианазин, диносебацетат, динотерб, дифенамид, динпропетрин, гукват, гитиопир, гигурон, DNOC, PPX-A 788, DPX-E96361, DSMA, еглауазин, ендотал, EPTC, еспрокарб, еталфлуралин, етидигмурон, етофумезат, феноксапроп, феноксапроп-Р, фенурон, флампроп, флампроп-М, флазасулфурон, флауазифон, флауазифон-Р, флауалоралин, флуметурон, флауорогликофен, флауоронитрофен, флаупропанат, флауренол, флауридон, флаурохлауридон, флауороксипир, циклоат, циклоксидим, 2,4-D, гаимурон, галапон, газомет, 2,4-DB, гезмедифам, гезметрин, гикамба, гихлорбенил, изопротурон, изоурон, изоксабен, изоксапирифон, лактофен, ленацил, линурон, LS830556, МСРА, МСРА-тиоетил, МСРВ, мекопроп, мекопроп-Р, мефенацет, мефлуидид, метам, метамитрон, метазахлор, метабензтиазурон, метазол, метопроптрин, метилдигморон, метилизотиоцианат, метобромурон, фомозафен, фозамин, фурилоксифен, глуфозинат, глифозат, халоксифон, хексазион, имазаметабенз, имазапир, имазаквин, имазетанпир, йоксинил, изопропалин, пропизамид, просулфокаб, пиразолинат, пиразолсулфурон, пиразоксифен, пирибутикарб, пиригат, квинклорак, квинмерак, квиноклоамин, квизизалофон-Р, S-23121, сетоксидим, сифурон, симазин, симетрин, SMY 1500, натриев

хлорат, сулфометурон, кампанени масла, ТСА, метолахлор, метоксурон, метрибзин, метсулфурон, молинат, моналид, монолинурон, MSMA, напроанилид, напропамид, напталам, небурон, никосулфурон, нипираклофен, норфлауразон, орбенкарб, оаризалин, оксадиазон, оксифлуорфен, паракват, пебулат, пендиметалин, пентахлорофенол, пентаохлор, нефтени масла, фенмедирам, пиклорам, пиперофос, претилахлор, примисулфурон, прогуамин, проглиназин, пропметон, прометрин, пропахлор, тебутам, тебуттиурон, тербацил, тербуметон, тербуттилазин, тербутрин, тиазафлуорон, тифенсулфурон, тиобенкарб, тиокарбазил, тиоклорим, тралкоксидим, три-алат, триазулфурон, трибензулон, триклопур, тридифан, триетазин, трифлуралин, IBI-C4874 Вернолат, пропанил, пропаквизафон, пропазин, профам.

Тегловните съотношения на активните съединения в тези комбинации могат да варирам в относително широки граници.

Активното съединение в комбинациите от активни съединения достига съдържание от 0.1 до 99.9%, по-точно от 1 до 75%, като особено предпочитано е количеството то 5 до 50%. Остатъкът до 100% се попълва с едно или повече от споменатите по-горе съкомпоненти.

Бактерицидните състави или концентрати, използвани за защита на промишлени материали, включват активното съединение и/или комбинация от активни съединения в концентрация от 0.01 до 95% тегловни и по-специално - от 0.1 до 60% тегловни.

Концентрациите, в които се използва активното съединение и/или комбинацията от активни съединения, зависи от природата и разпространението на микроорганизмите, които ще бъдат атакувани, и от състава на защитавания материал.

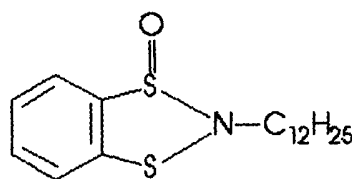
Оптималното за прилагане количество може да бъде определено чрез серия изпитвания. Приложимата концентрация е в интервала от 0.001 до 5% тегловни, за предпочитане от 0.05 до 1.0% тегловни по отношение на материала, който е обект на защита.

Активните съединения и състави съгласно изобретението дават възможност по подходящ начин да бъдат заместени наличните в момента бактерицидни състави с по-ефективни състави. Те притежават добра стабилност и, като предимство, широк спектър на действие.

Следващите примери служат за илюстриране на изобретението. Последното не се ограничава до примерите.

Примери за получаване на съединенията

Пример 1



1.35 g (4.2 mmol) от N-(n-додецил)-бензодитиазол се разтварят в 20 ml хлороформ. Разтворът се охлажда до -20°C и на порции се прибавят общо 1.26 g (4 mmol) 56% m-хлоропербензоена киселина. Сместа се разбърква 2 часа при 0°C , измива се с наситен разтвор на NaHCO_3 , с разтвор и с наситен разтвор на NaCl , изсушава се над Na_2SO_4 и се концентрира.

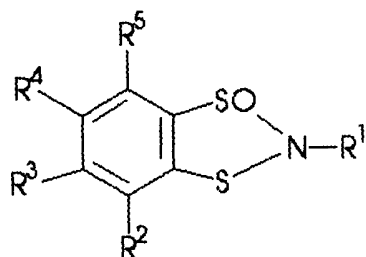
Остатъкът се пречиства чрез хроматографиране върху силикагел (толуен:етилацетат = 1:1).

Добив 0.7 g (Δ 50% от теоретичния) бледожълто масло

^1H ЯМР (CDCl_3) δ = 0.9 (3H, t); 1.1-1.7 (23H, m); 3.5 (2H, t), 7.2-7.9 (4H, m).

Аналогично на този пример и в съответствие с дадените по-горе общи инструкции са получени съединенията с формула (I), описани в Таблица 1.

Таблица 1



(I)

Пр. No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Физични константи
1	-C ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H	Виж Примера за получаване
2	-C ₈ H ₁₇	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.85 (3H,t); 1.2-1.5 (10H,m); 1.85 (2H,tq); 3.50 (2H,t); 7.30 (1H,m); 7.48 (2H,m); 7.85 (1H,d).
3	-H	H	H	H	H	
4	-CH ₃	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=3.25 (3H,s); 7.3 (1H,m); 7.5 (2H,m); 7.83 (1H,d).
5	-C ₂ H ₅	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.43 (3H,t); 3.57 (2H,q); 7.26 (1H,m); 7.49 (2H,m); 7.81 (1H,d).
6	-C ₃ H ₇	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.0 (3H,t); 1.82 (2H,m); 3.47 (2H,t); 7.29 (1H,m); 7.4 (2H,m); 7.83 (1H,d).
7	-CH(CH ₃) ₂	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.38 (3H,d); 1.44 (3H,d); 4.12 (1H,m); 7.3 (1H,m); 7.46 (2H,m); 7.8 (1H,d).
8	-C ₄ H ₉	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.95 (3H,t); 1.45 (2H,m); 1.75 (2H,m); 3.50 (2H,t); 7.30 (1H,m); 7.45 (2H,m); 7.80 (1H,d).
9	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.0 (6H,m); 2.1 (1H,m); 3.27 (2H,d); 7.26 (1H,m); 7.45 (2H,m); 7.82 (1H,d).

Таблица 1 - продължение

Пр. No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Физични константи
10	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \diagup \\ -\text{CH} \\ \diagdown \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ =0.88/0.99 (3H,2xd); 1.26/1.43 (3H,2xt); 1.5-1.9 (2H,m); 3.9 (1H,m); 7.3 (1H,m); 7.48 (2H,m); 7.82 (1H,d). (Диастереомерна смес)
11	-CH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ =4.1 (2H,d); 5.3-5.5 (2H,m); 6.0 (1H,m); 7.30 (1H,m); 7.45 (2H,m); 7.80 (1H,d).
12	-CH ₂ C≡CH	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ =2.37 (2H,m); 4.29 (2H,AB система); 7.3 (1H,m); 7.45 (2H,m); 7.8 (1H,d).
13	-C ₅ H ₁₁	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ =0.9 (3H,t); 1.3 (4H,m); 1.78 (2H,m); 3.49 (2H,t); 7.3 (1H,m); 7.45 (2H,m); 7.80 (1H,d).
14	-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ =0.9 (3H,t); 1.3 (6H,m); 3.50 (2H,t); 7.32 (1H,m); 7.45 (2H,m); 7.80 (1H,d).
15	-C ₇ H ₁₅	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ =0.9 (3H,t); 1.35 (8H,m); 3.50 (2H,t); 7.3 (1H,m); 7.45 (2H,m); 7.80 (1H,d).
16	-C ₉ H ₁₉	H	H	H	H	
17	-C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H	
18	-C ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H	
19	-C ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H	
20	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ =3.25 (3H,s); 3.5-3.8 (4H,m); 7.27 (1H,m); 7.48 (2H,m); 7.80 (1H,d)

Таблица 1 - продолжение

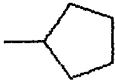
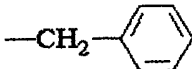
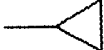
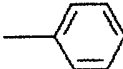
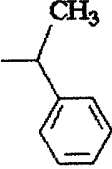
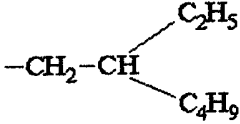
Пр. No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Физични константи
21		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.5-2.2 (8H,m); 4.07 (1H,m); 7.30 (1H,m); 7.48 (2H,m); 7.80 (1H,d).
22		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=4.63 (2H, AB система); 7.2-7.4 (8H,m); 7.80 (1H,d).
23		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.9-1.1 (4H,m); 2.93 (1H,m); 7.3 (1H,m); 7.48 (2H,m); 7.8 (1H,d).
24		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=7.1-7.6 (8H,m); 7.88 (1H,d).
25		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.85 (3H,t); 4.90/4.90 (1H,2xq); 7.1-7.5 (8H,m); 7.82 (1H,d).
26		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.8-1.0 (6H,m); 1.2-1.6 (8H,m); 1.79 (1H,m); 3.39 (2H,m); 7.3 (1H,m); 7.48 (2H,m); 7.82 (1H,d).
27	-C ₁₆ H ₃₃	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.87 (3H,t); 1.2 (26H,m); 1.81 (2H,m); 3.50 (2H,t); 7.3 (1H,m); 7.48 (2H,m); 7.82 (1H,d).
28	-C ₁₈ H ₃₇	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.87 (3H,t); 1.2 (2H,m); 1.80 (2H,m); 3.48 (2H,t); 7.3 (1H,m); 7.48 (2H,m); 7.80 (1H,d).

Таблица 1 - продължение

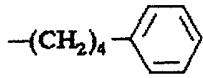
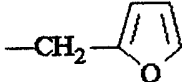
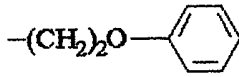
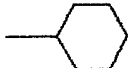
Пр. No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Физични константи
29		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=2.6-2.9 (4H,m); 2.67 (2H,t); 3.50 (2H,t); 7.1-7.5 (8H,m); 7.82 (1H,d).
30	-C ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.87 (3H,t); 1.2 (24H,m); 1.81 (2H,m), 3.49 (2H,t); 7.30 (1H,m); 7.50 (2H,m); 7.82 (1H,d).
31	-(CH ₂) ₃ OC ₄ H ₉	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.92 (3H,t); 1.35 (2H,m); 1.55 (2H,m); 2.07 (2H,m); 3.44 (2H,t); 3.49 (2H,t); 3.65 (2H,t); 7.31 (1H,m); 7.50 (2H,m); 7.81 (1H,d).
32		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=4,6 (2H, АВ система); 6.35 (1H, d); 6.46 (1H, d); 7.25-7.55 (4H,m); 7.83 (1H,d).
33	-C ₈ H ₁₇	H	H	F	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.8 (3H,t); 1.2 (10H,m); 0.8-2.0 (2H,m); 3.5/3.9 (2H,2xt); 7.0-8.0 (3H,m).
34		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=3.97 (2H,m); 4.23 (2H,m); 6.9-7.5 (8H,m); 7.84 (1H,d).
35		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.0-2.2 (10H,m); 3.7 (1H,m); 7.3 (1H,m); 7.48 (2H,m); 7.84 (1H,d).
36	-C(CH ₃) ₄	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.61 (9H,s); 7.26 (1H,m); 7.48 (2H,m); 7.80 (1H,d).

Таблица 1 - продължение

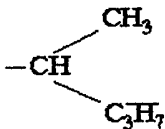
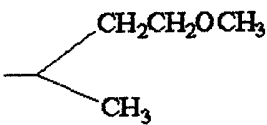
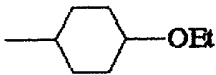
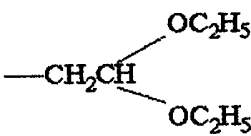
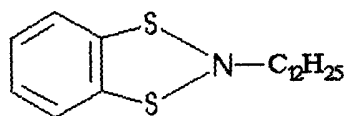
Пр. No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Физични константи
37		H	H	H	H	масло
38		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.1-1.2 (6H,m); 1.48 (2H,d); 1.7-2.0 (2H,m); 3.3-3.7 (4H,m); 4.2-4.4 (1H,m); 7.3 (1H,m); 7.48 (2H,m); 7.81 (1H,d).
39		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.23 (3H,t); 1.3-2.3 (8H,m); 3.2 (1H,m); 3.5 (2H,q); 3.7 (1H,m); 7.3 (1H,m); 7.45 (2H,m); 7.81 (1H,d).
40	-циклоC ₈ H ₁₅	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ= 1.3-2.1 (14H,m) 4.05 (1H,m); 7.35 (1H,m); 7.45 (2H,m); 7.85 (1H,d).
41		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.3 (6H,m); 3.4-3.8 (6H,m); 4.74 (1H,m); 7.26 (1H,m); 7.48 (2H,m); 7.84 (1H,m).
42	-CH ₃	H	Cl	H	Cl	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=3.26 (3H,s); 7.45 (1H,s); 7.71 (1H,s).
43	-CH ₂ CH=CH ₂	H	Cl	H	Cl	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ= 4.1 (2H,m); 5.5 (2H,m); 5.98 (1H,m); 7.25/7.34/7.46/7.71 (2H,x4s).
44	-C ₈ H ₁₇	H	Cl	H	Cl	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.88 (3H,t); 1.3 (9H,m); 1.90 (2H,m); 3.84 (2H,t); 7.6-7.9 (2H,x4s).

Таблица 1 - продължение

Пр. No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Физични константи
45	$-(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_3\text{OC}_2\text{H}_5$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.21 (3H,t); 3.45-3.9 (14H,m); 7.35 (1H,m); 7.48 (2H,m); 7.82 (1H,d).
46	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=2.95 (1H,br); 3.6-4.0 (4H,m); 7.35 (1H,m); 7.52 (2H,m); 7.85 (1H,d).
47	$-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.19 (t,3H); 4.16 (q,2H); 4.26 (d,2H); 7.32-7.51 (m,3H); 7.85 (m,1H).
48	$-\text{CH}(\text{Ph})\text{CO}_2^t\text{Bu}$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.38 и 1.43 (s,9H); 2.16 (s,1H); 7.26-7.52 (m,8H); 7.75 (m,1H).
49	$-\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{CO}_2\text{CH}_3$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.65 (3H); 3.49 и 3.69 (3H); 4.49-4.71 (1H); 7.27-7.49 (3H); 7.83(1H).
50	$-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2)-\text{CO}_2\text{CH}_3$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=3.45 и 3.68 (3H); 4.52 (1H); 7.30-7.48 (3H); 7.86 (1H).
51	$-\text{CH}(\text{i-Pr})\text{CO}_2\text{Et}$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.87-1.26 (9H); 2.43 (1H); 3.88 (1H); 4.03-4.20 (2H); 7.21-7.34 (m,1H); 7.47 (1H); 7.82(1H).
52	$-\text{CH}(\text{CH}_2\text{Ph})\text{CO}_2\text{Et}$	H	H	H	H	MS: m/z 348

Пример II-1

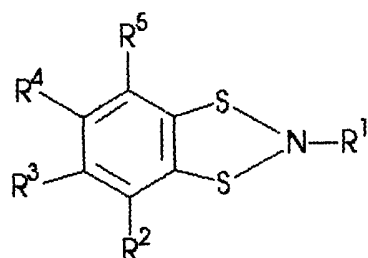
2.11 g (10 mmol) се разтварят в етер и разтворът се прибавя към смес, охладена до -20°C от 1.85 g (10 mmol) додециламин и 2.42 g (24 mmol) триетиламин. Сместа се разбърква 5 часа при стайна температура, филтрува се и филтратът се концентрира на ротационен изпарител. Пречиства се чрез хроматографиране върху силикагел. (толуен).

Добив 2.5 g (Δ 74% от теоретичния)

^1H ЯМР (CDCl_3) $\delta =$ 0.85 (3H, t); 1.1-1.3 (21H, m); 1.5 (2H, m), 2.85 (2H, t), 7.1-7.5 (4H, m).

Аналогично на този пример и в съответствие с дадените по-горе общи инструкции са получени съединенията с формула (II), описани в Таблица 2.

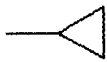
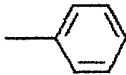
Таблица 2



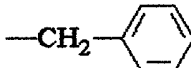
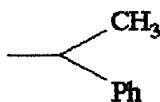
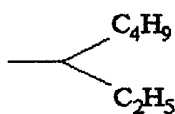
(II)

Пр. No.	R¹	R²	R³	R⁴	R⁵	Физични константи
1	-C ₁₂ H ₂₅					Виж Примера за получаване II-1
2	-C ₈ H ₁₇					¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.85 (3H,t); 1.1-1.4 (10H,m); 1.55 (2H,m); 2.90 (2H,t); 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m).
3	-H	H	H	H	H	
4	-CH ₃	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=2.9 (3H,s); 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m).
5	-C ₂ H ₅	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.05 (3H,t); 2.95(2H,q); 7.20 (2H,m); 7.35 (2H,m).
6	-C ₃ H ₇	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.90 (3H,t); 1.55 (2H,m); 2.85 (2H,t); 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m).
7	-CH(CH ₃) ₂	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.05 (6H,d); 3.0 (1H,dq); 7.10 (2H,m); 7.30 (2H,m).
8	-C ₄ H ₉	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.85 (3H,t); 1.30 (2H,m); 1.55 (2H,m); 2.90 (2H,t); 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m).
9	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.90 (6H,d); 1.90 (1H,m); 2.70 (2H,d); 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m).
10		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.85 (3H,t); 1.0 (3H,2); 1.35 (1H,m); 1.60 (1H,m); 2.75 (1H,m); 7.10 (2H,m); 7.35 (2H,m).

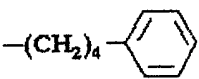
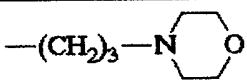
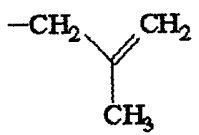
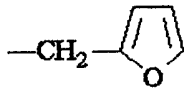
Пример II-1 - продължение

Пр. No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Физични константи
11	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=3.50 (2H,d); 5.1-5.3 (2H,m); 5.8 (1H,m); 7.18 (2H,m); 7.35 (2H,m).
12	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=2.30 (1H,t); 3.65 (2H,d); 7.15 (2H,m); 7.30 (2H,m).
13	$-\text{C}_5\text{H}_{11}$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.85 (3H,t); 1.2 (4H,m); 1.5 (2H,m); 2.85 (2H,t); 7.15 (2H,m); 7.30 (2H,m).
14	$-\text{C}_6\text{H}_{13}$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.85 (3H,t); 1.2 (6H,m); 1.50 (2H,m); 2.90 (2H,t); 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m).
15	$-\text{C}_{12}\text{H}_{25}$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.90 (3H,t); 1.1-1.7 (20H,m); 2.88 (2H,t), 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m).
16		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.6-0.8 (4H,m); 2.90 (1H,m); 7.20 (2H,m); 7.38 (2H,m).
17		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=7.0-7.5 (9H,m).

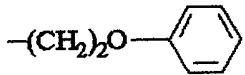
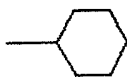
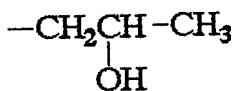
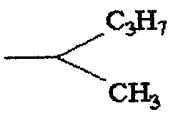
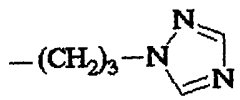
Пример II-1 - продолжение

Пр. No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Физични константи
18	-C ₇ H ₁₅	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.90 (3H,t); 1.2 (8H,m); 1.50 (2H,m); 2.85 (2H,t); 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m).
19		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=4.0 (2H,s); 7.1-7.4 (9H,m).
20		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.4-1.8 (8H,m); 3.30 (1H,m); 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m).
21	-(CH ₂) ₂ OCH ₃	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=3.0 (2H,t); 3.30 (3H,s); 3.5 (2H,t); 7.2 (2H,m); 7.45 (2H,m).
22		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.45 (3H,d); 3.90 (1H,q); 7.10 (2H,m); 7.2-7.4 (7H,m).
23		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.7-0.9 (6H,m); 1.1-1.7 (8H,m); 2.90 (2H,d); 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m).
24	-C ₁₆ H ₃₃	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.90 (3H,t); 1.2 (26H,m); 1.5 (2H,m); 2.85 (2H,t); 7.20 (2H,m); 7.30 (2H,m).
25	-C ₁₈ H ₃₇	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.90 (3H,t); 0.2 (28H,m); 2.85 (2H,t); 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m).

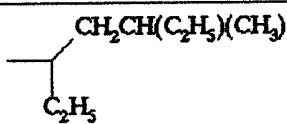
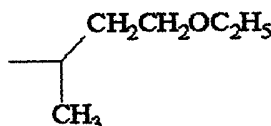
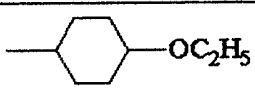
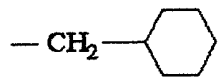
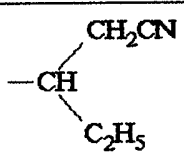
Пример II-1 - продължение

Пр. No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Физични константи
26		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.5 (4H,m); 2.5 (2H,t); 2.9 (2H,t); 7.1-7.4 (9H,m).
27		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.75 (2H); 2.40 (6H); 2.95 (2H,t); 3.70 (4H,m) 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m).
28	-C ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.85 (3H,t); 1.25 (22H,m); 1.5 (2H,m); 2.9 (2H,t); 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m).
29	-(CH ₂) ₃ OC ₄ H ₉	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.8 (3H,t); 1.2 (2H,m); 1.5 (2H,m); 1.8 (2H,m); 3.0 (2H,t); 3.4 (4H,m); 7.1 (2H,m); 7.35 (2H,m).
30		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=1.7 (3H,s); 3.4 (2H,s); 4.85 (1H,s); 4.90 (1H,s); 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m).
31		H	H	H	H	m. m. = 158°C
32	-C ₈ C ₁₇	H	H	F	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=0.8 (3H,t); 1.2 (10H,m); 1.5 (2H,m); 2.9 (2H,t); 6.85 (1H,m); 7.05 (1H,m); 7.20 (1H,m).
33		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ=3.95 (2H,s); 6.35 (2H,m); 7.2 (2H,m); 7.3 (3H,m).

Пример II-1 - продовження

Пр. No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Фізичні константи
34	-CH ₃	H	H	F	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 2.8 (3H,s); 6.9 (1H,dt); 7.1 (1H,dd); 7.25 (1H,m).
35		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 3.2 (2H,t); 4.0 (2H,t); 7.0-7.5 (9H,m).
36		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 1.0-2.0 (10H,m); 2.50 (1H,m); 7.2 (2H,m); 7.35 (2H,m).
37	-CH ₂ CH ₂ OH	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 2.0 (1H,br); 3.05 (2H,t); 3.70 (2H,t); 7.15 (2H,br); 7.35 (2H,br).
38		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 1.05 (3H,d); 2.50 (1H,br); 2.70 (1H,m); 3.05 (1H,m); 3.95 (1H,m); 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m).
39	-C(CH ₃) ₄	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 1.05 (9H,s); 7.05 (2H,m); 7.15 (2H,m).
40		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 0.80 (3H,t); 1.0 (3H,d); 1.20 (2H,m); 1.50 (2H,m); 2.80 (1H,m).
41		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 2.05 (2H,m); 2.85 (2H,t); 4.30 (2H,t); 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m); 7.95 (1H,s); 8.10 (1H,s).

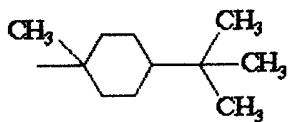
Пример II-1 - продолжение

Пр. No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Физични константи
42		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 0.7-0.8 (9H,m); 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m).
43		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 0.9 (3H,d); 1.05 (3H,t); 1.5 (H,m); 1.9 (1H,m); 3.05 (1H,m); 3.45 (4H,m); 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m);.
44		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 1.05 (3H,t); 1.1-2.5 (9H,m); 3.2-3.5 (3H,m); 7.15 (2H,m); 7.30 (2H,m).
45		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 0.8-1.8 (11H,m); 2.75 (2H,d); 7.20 (2H,m); 2.35 (2H,m).
46	-CH ₂ CH(OC ₂ H ₄) ₂	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 1.05 (6H,t); 3.5-3.8 (6H,m); 4.5 (2H,t) 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m).
47		H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 0.95 (3H,t); 1.50 (2H,m); 2.50 (1H,m); 2.40 (2H,d); 7.1 (2H,m); 7.3 (2H,m).
48	циклоC ₈ H ₁₅	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 1.2-2.0 (14H,m); 2.80 (1H,m); 7.15 (2H,m); 7.30 (2H,m);

Пример II-1 - продължение

Пр. No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Физични константи
49	$-(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_2\text{-C}_4\text{H}_9$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 0.85 (3H,t); 1.30 (2H,m); 3.15 (2H,t); 3.40 (2H,m); 3.5-3.7 (6H,m); 7.15 (2H,m); 7.35 (6H,m).
50	$-(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_2\text{CH}_3$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 3.30 (3H,s); 3.3-3.9 (8H,m); 7.15 (2H,m); 7.35 (2H,m);.
51	$-(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_3\text{CH}_3$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 3.15 (3H,t); 3.38 (3H,s); 3.5-3.7 (10H,m); 7.1 (2H,m); 7.3 (2H,m).
52	$-(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_3\text{C}_2\text{H}_5$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 1.22 (3H,t); 3.12 (2H,t); 3.5-3.8 (12H,m) 7.1 (2H,m); 7.35 (2H,m).
53	$-\text{CH}(\text{Ph})\text{CO}_2^t\text{Bu}$	H	H	H	H	m. m.: 132-133°C
54	$-\text{CH}(\text{CH}_2\text{Ph})\text{CO}_2\text{Et}$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 1.01 (3H); 2.98-3.27 (2H); 3.73 (1H); 3.90 (2H); 7.09-7.36 (9H).
55	$-\text{CH}(\text{i-Pr})\text{CO}_2\text{Et}$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 0.94 (6H); 1.21 (3H); 2.35 (1H); 3.31 (1H); 4.03 (2H); 7.12-7.39 (4H).
56	$-\text{CH}(\text{i-Pr})\text{CONH-CH}(\text{CH}_3)\text{Ph}$	H	H	H	H	m. m.: 156.9°C
57	$-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CO}_2^t\text{Bu}$	H	H	H	H	m. m.: 98°C
58	$-(\text{CH}_2)_2\text{CO}_2^t\text{Bu}$	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 1.43 (s,9H); 2.48 (t,2H); 3.16 (t,2H); 7.14-7.36 (4H);

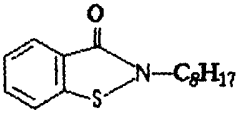
Пример II-1 - продължение

Пр. No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Физични константи
59	-CH ₂ -CO ₂ ^t Bu	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 1.47 (s, 9H); 3.66 (s, 2H); 7.15-7.36 (m, 4H).
60	-CH(CH ₃)CO ₂ CH ₃	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 1.37 (d, 3H); 3.60 (q, 1H); 3.70 (s, 3H); 7.13-7.34 (4H).
61	-CH(CH ₂ -CH(CH ₃) ₂)CO ₂ CH ₃	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 0.86 (6H); 1.53 (1H); 1.67 (2H); 3.50 (1H); 3.55 (3H); 7.13-7.34 (4H).
62	-CH(i-Pr)CO ₂ ^t Bu	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 0.96 (6H); 1.39 (9H); 3.19 (1H); 7.12-7.32 (4H).
63	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₃	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 1.00 (9H); 1.04 (6H); 1.58 (2H); 7.05-7.28 (4H);
64		H	H	H	H	m. m.: 178°C
65	-C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₅ -C(CH ₃) ₃	H	H	H	H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ = 0.60-1.60 (25H); 7.08 (2H); 7.25 (2H).

Пример за приложение на съединенията:

С цел да се покаже активността срещу гъби е определена минималните инхибиращи концентрации (MICs) на състави съгласно изобретението:

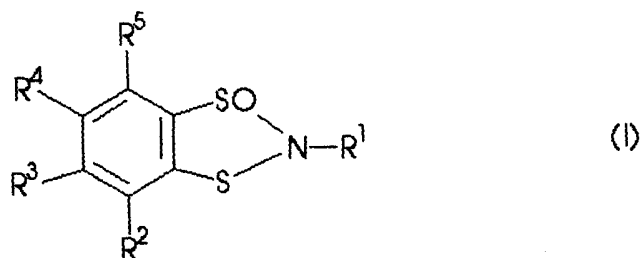
Агара, приготвен с използване на малцов екстракт, е обработен с активни съединения съгласно изобретението в концентрации от 0.1 mg/l до 5000 mg/l. След втвърдяване на агара последният е заразен с чисти култури от изпитваните организми, изброени в Таблица 1. След съхраняване в продължение на 2 седмици при 28°C и 60 до 70% относителна атмосферна влажност е определена най-малката концентрация на активното съединение (MIC), при която образците от използваните микроби не нарастват и е посочена в следващата Таблица 3.

Съединение	MIC/ppm Penicillin breviculae	MIC/ppm Chaetomium globosum	MIC/ppm Aspergillus niger
	>600	>100	>600
1	<600	<100	<600

31.07.98

ПАТЕНТНИ ПРЕТЕНЦИИ

1. Приложение на 1,3,2-бензодитиазол-1-оксиди с обща формула (I)



където

R^1 представлява водород, евентуално заместен алкил, алкенил, алкинил, алкокси, циклоалкил, арил, хетероарил или аралкил, или хетероарилалкил, и

R^2 , R^3 , R^4 и R^5 , независимо един от друг представляват водород, халоген, алкил, халогеноалкил, алкокси, халогеноалкокси, алкилтио, халогеноалкилтио, диалкиламино, нитро или циано, които са подходящи като бактерициди за защитаване на промишлени материали.

2. Приложение съгласно претенция 1, при което се използват съединения с формула (I), в които

R^1 представлява водород, правоверижан или разклонен алкил, съдържащ от 1 до 18 въглеродни атома, правоверижан или разклонен алкенил, съдържащ от 2 до 18 въглеродни атома, правоверижан или разклонен алкинил, съдържащ от 2 до 18 въглеродни атома, който евентуално е заместен еднократно или многократно с еднакви или различни заместители, включващи халоген, алкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 9 еднакви или различни халогенни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 9 еднакви или различни халогенни

атома, ацил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, (алкокси)-карбонил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, амино, който евентуално е заместен с еднакви или различни заместители, включващи алкил или арил, евентуално заместен фенокси или пиридилокси, нитро или циано;

представлява циклоалкил, състоящ се от 1 до 4 свързани помежду си пръстенни системи, притежаващи от 3 до 18 въглеродни атома, който евентуално е заместен еднократно или многократно с еднакви или различни заместители, включващи халоген, алкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 5 еднакви или различни халогенни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 5 еднакви или различни халогенни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 5 еднакви или различни халогенни атома, нитро или циано;

представлява арил, който евентуално е заместен еднократно или петкратно с халоген, алкил, съдържащ от 1 до 10 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома и от 1 до 8 еднакви или различни халогенни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 10 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома и от 1 до 8 еднакви или различни халогенни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 10 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома и от 1 до 8 еднакви или различни халогенни атома, амино, моноалкиламино, съдържащ правоверижни или разклонени алкилни радикали, притежаващи от 1 до 6 въглеродни атома, гуалкиламино, съдържащ еднакви или различни, правоверижни или разклонени

алкилни радикали, всеки от които има от 1 до 6 въглеродни атома, циклоалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, метилендиокси, дифлуорометилендиокси, хлорофлуорометилендиокси, дихлорометилендиокси, нитро или циано; и

представлява аралкил, в който алкилният радикал е правоверижен или разклонен, и който се състои от 1 до 8 въглеродни атома, и арил, който за предпочитане представлява фенил, евентуално заместен от еднократно до четирикратно с еднакви или различни заместители, включващи халоген, алкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, аминоксид, съдържащ правоверижни или разклонени алкилни радикали, притежаващи от 1 до 6 въглеродни атома, гуакиламино, съдържащ еднакви или различни, правоверижни или разклонени алкилни радикали, всеки от които има от 1 до 6 въглеродни атома, циклоалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, метилендиокси, дифлуорометилендиокси, хлорофлуорометилендиокси, дихлорометилендиокси, нитро или циано,

R^2 , R^3 , R^4 и R^5 , независимо един от друг представляват водород, халоген, алкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, алкилтио,

съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкилно, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, диалкиламино, съдържащ еднакви или различни, правовеижни или разклонени алкилни радикали, всеки от които има от 1 до 6 въглеродни атома, нитро или циано.

3. Приложение съгласно претенция 1, при което са използвани съединения с формула (I), в които

R^1 представлява водород, правовеижен или разклонен алкил, съдържащ от 1 до 14 въглеродни атома, правовеижен или разклонен алкенил, съдържащ от 2 до 14 въглеродни атома или правовеижен или разклонен алкинил, съдържащ от 2 до 14 въглеродни атома, който евентуално е заместен от еднократно до четирикратно с еднакви или различни заместители, включващи флуор, хлор, алкокси, съдържащ от 1 до 5 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 5 въглеродни атома и от 1 до 5 флуорни и/или хлорни атома, алкилно, съдържащ от 1 до 5 въглеродни атома, халогеноалкилно, съдържащ от 1 до 5 въглеродни атома и от 1 до 5 флуорни и/или хлорни атома, ацил, съдържащ от 1 до 5 въглеродни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 5 въглеродни атома, алкоксикарбонил, съдържащ 1 до 5 въглеродни атома, амино, който евентуално е заместен с еднакви или различни заместители, включващи алкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и/или фенил, фенокси или пиридилокси, нитро или циано;

представлява циклоалкил, състоящ се от 1 до 3 пръстенни системи, притежаващи от 3 до 14 въглеродни атома, който евентуално е заместен от еднократно до четирикратно с еднакви или различни заместители, включващи флуор/хлор, алкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, алкилно, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, нитро или циано;

представлява арил, който евентуално е заместен от еднократно до четирикратно с флуор, хлор, алкил, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 флуорни и/или хлорни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 флуорни и/или хлорни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 флуорни и/или хлорни атома, амино, моноалкиламино, съдържащ алкилни радикали, притежаващи от 1 до 4 въглеродни атома, гуалкиламино, съдържащ еднакви или различни, правоверижни или разклонени алкилни радикали, всеки от които има от 1 до 4 въглеродни атома, циклоалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, метилендиокси, дифлуорометилендиокси, хлорофлуорометилендиокси, дихлорометилендиокси, нитро или циано; и

представлява аралкил, в който алкилният радикал е правовериден или разклонен и който се състои от 1 до 8 въглеродни атома, и арил, който за предпочитане представлява фенил, евентуално заместен от еднократно до четирикратно с флуор, хлор, алкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 4 флуорни и/или хлорни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 4 флуорни и/или хлорни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 4 флуорни и/или хлорни атома, амино, моноалкиламино, съдържащ алкилни радикали, притежаващи от 1 до 4 въглеродни атома, гуалкиламино, съдържащ еднакви или различни алкилни радикали, всеки от които има от 1 до 4 въглеродни атома, циклоалкил, съдържащ от 1 до 6

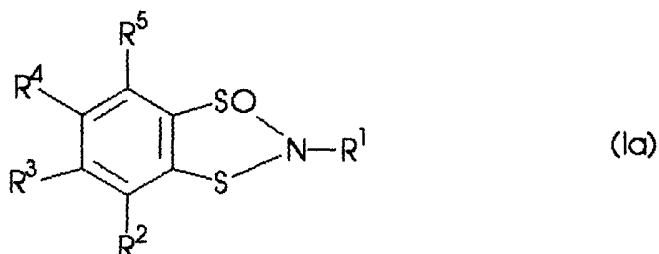
представлява арил, който евентуално е заместен от еднократно до четирикратно с флуор, хлор, алкил, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 флуорни и/или хлорни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 флуорни и/или хлорни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 флуорни и/или хлорни атома, амино, моноалкиламино, съдържащ алкилни радикали, притежаващи от 1 до 4 въглеродни атома, гуалкиламино, съдържащ еднакви или различни, правоверижни или разклонени алкилни радикали, всеки от които има от 1 до 4 въглеродни атома, циклоалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, метилендиокси, дифлуорометилендиокси, хлорофлуорометилендиокси, дихлорометилендиокси, нитро или циано; и

представлява аракил, в който алкилният радикал е правоверижен или разклонен и който се състои от 1 до 8 въглеродни атома, и арил, който за предпочитане представлява фенил, евентуално заместен от еднократно до четирикратно с флуор, хлор, алкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 4 флуорни и/или хлорни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 4 флуорни и/или хлорни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 4 флуорни и/или хлорни атома, амино, моноалкиламино, съдържащ алкилни радикали, притежаващи от 1 до 4 въглеродни атома, гуалкиламино, съдържащ еднакви или различни алкилни радикали, всеки от които има от 1 до 4 въглеродни атома, циклоалкил, съдържащ от 1 до 6

въглеродни атома, метилендиокси, дифлуорометилендиокси, хлорофлуорометилендиокси, дихлоро-метилендиокси, нитро или циано;

R^2 , R^3 , R^4 и R^5 , независимо един от друг представляват водород, хлор, флуор, алкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 6 флуорни и/или хлорни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 6 флуорни и/или хлорни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 4 въглеродни атома и от 1 до 6 флуорни и/или хлорни атома, диалкиламино, съдържащ еднакви или различни, правоверижни или разклонени алкилни радикали, всеки от които има от 1 до 6 въглеродни атома, нитро или циано.

4. 1,3-Бензодитиазол-1-оксиди с формула (Ia)



В които

R^1 представлява водород, правоверижен или разклонен алкил, съдържащ от 13 до 18 въглеродни атома, правоверижен или разклонен алкенил или алкинил, съдържащ от 17 до 18 въглеродни атома, и представлява правоверижен или разклонен алкил, съдържащ от 1 до 18 въглеродни атома, който евентуално е заместен еднократно или многократно с еднакви или различни заместители, включващи халоген, алкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 9 еднакви или различни халогенни атома, алкилтио,

различни халогенни атома, нитро или циано;

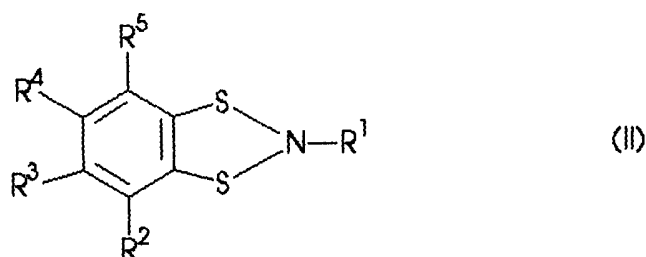
представлява арил, който евентуално е заместен от еднократно до петкратно с алкил, съдържащ от 5 до 10 въглеродни атома, халогеноалкил, съдържащ от 5 до 8 въглеродни атома и от 1 до 8 еднакви или различни халогенни атома, алкокси, съдържащ от 5 до 10 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома и от 1 до 8 еднакви или различни халогенни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 10 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 8 въглеродни атома и от 1 до 8 еднакви или различни халогенни атома, амино, моноалкиламино и правоверижни или разклонени алкилни радикали, притежаващи от 1 до 6 въглеродни атома, циклоалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, метилендиокси, дифлуорометилендиокси, хлорофлуорометилендиокси, дихлорометилендиокси, нитро или циано; и

представлява аракил, в който алкилният радикал е правоверижен или разклонен и се състои от 5 до 8 въглеродни атома, и арил, който за предпочитане представлява фенил, евентуално заместен еднократно или четирикратно с еднакви или различни заместители, включващи, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, амино, моноалкиламино, съдържащ правоверижни или разклонени алкилни радикали, притежаващи от 1 до 6 въглеродни атома, циклоалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, метилендиокси, дифлуорометилендиокси, хлорофлуорометилендиокси, дихлорометилендиокси, нитро или циано;

R^2 , R^3 , R^4 и R^5 , независимо един от друг представляват водород, халоген, алкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома,

халогеноалкил, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, алкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, халогеноалкокси, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, алкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома, и халогеноалкилтио, съдържащ от 1 до 6 въглеродни атома и от 1 до 6 еднакви или различни халогенни атома, диакиламино, съдържащ еднакви или различни, правоверижни или разклонени алкилни радикали, всеки от които има от 1 до 6 въглеродни атома, нитро или циано.

5. Метод за получаване на 1,3,2-бензодитиазол-1-оксиди с обща формула (I), в която R^1 , R^2 , R^3 , R^4 и R^5 имат дадените в претенция 4 значения, характеризиращ се с това, че съединения с обща формула (II)



в която R^1 , R^2 , R^3 , R^4 и R^5 имат дадените по-горе значения, се подлагат на взаимодействие с окислител, обикновено в присъствието на разреждатели.

6. Бактерицидни състави за защита на промишлени материали, характеризиращи се с това, че съдържат съединения с формули (I), (Ia) и/или (II) съгласно претенции 1, 4 и 5.

7. Метод за защита на промишлени материали, характеризиращ се с това, че съединения с формули (I), (Ia) и/или (II) съгласно претенции 1, 4 и 5 се нанасят върху защитаваните материали или се смесват с въпросните материали.