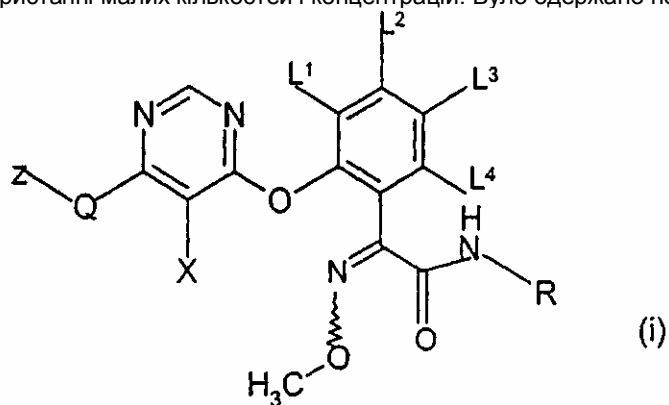


Винахід стосується нових галогенпіримідинів, двох способів їх одержання і їх застосування в якості засобу для боротьби із шкідниками.

Визначені піримідини з похжим заміщенням замісників, а також їх фунгіцидна дія стала вже відома (GB-A 2253624). Активність цих відомих сполук є задовільною не у всіх галузях застосування, особливо при використанні малих кількостей і концентрацій. Було одержано нові галогенпіримідини загальної формули (I),



в якій

Z означає заміщений або незаміщений циклоалкіл, арил або гетероцикліл,

R означає водень або алкіл,

Q означає кисень або сірку,

X означає галоген і

L¹, L², L³, L⁴ однакові або різні і, незалежно один від одного, означають відповідно водень, галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, заміщений або незаміщений галогеном алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл або алкілсульфоніл.

У використаних тут визначеннях насичених або ненасичених — вуглеводневих ланцюгів таких, як алкіл, алкандііл, алкеніл або алкініл, також і зв'язані з гетероатомами, як наприклад алкокси-, алкілтіо- або алкіламіно-ланцюг залежно від обставин прямий або розгалужений.

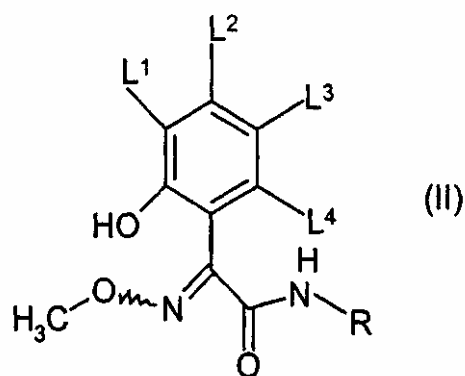
Арил означає ароматичне, моно- або поліциклічне вуглеводневе кільце, наприклад феніл, нафтил, антраніл, фенантріл, переважно феніл або нафтил, більш переважно феніл.

Гетероцикліл означає насичені або ненасичені, а також ароматичні циклічні сполуки, в яких, мінімум один ланцюг циклу є гетероатомом, тобто є атомом відмінним від вуглецю. Якщо цикл містить декілька гетероатомів, то вони можуть бути однакові або різні. Переважно коли гетероатомом є атом кисню, азоту або сірки. При необхідності, циклічні сполуки можуть утворювати з іншими карбоциклічними або гетероциклічними конденсованими або містечковими циклами єдину поліциклічну систему. Переважно моно- або біциклічну циклічну систему, більш переважно моно- або біциклічну ароматичну циклічну систему.

Циклоалкіл означає насичені карбоциклічні кільцеподібні сполуки, які при необхідності утворюють з іншими карбоциклічними, неконденсованими або містечковими циклами поліциклічну систему.

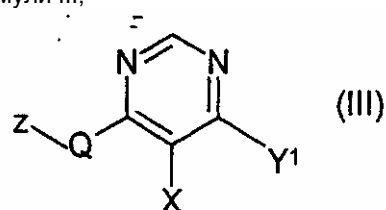
Надалі було знайдено, що нові галогенпіримідини загальної формули (I) можна одержати, коли

a) 2-(2-гідрокси-феніл)-2-метоксиіміно-ацетаміди формули (II),



в якій

R, L¹, L², L³ і L⁴ мають вищевказані значення, взаємодіють із заміщеним галогенпіримідином загальної формули III,



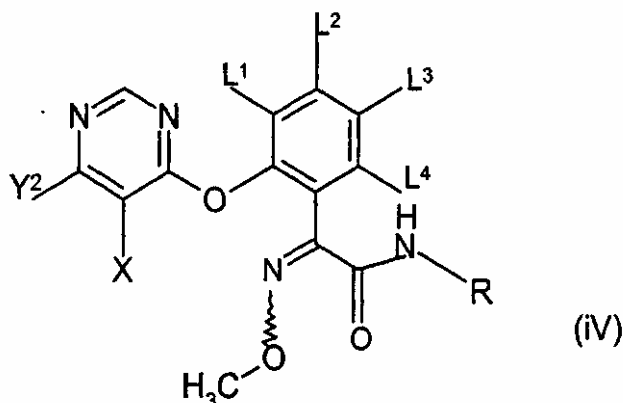
в якій

Z, Q і X мають значення які вказані вище і

Y¹ означає галоген,

реакція проходить при необхідності в присутності розчинника, при необхідності в присутності кислотного акцептора і при необхідності в присутності каталізатора, або коли

б) феноксіпіримідини загальної формули (IV)



в якій

R, L¹, L², L³ і L⁴ мають вищевказані значення і

Y² означає галоген,

взаємодіє з циклічними сполуками загальної формули (V),

Z-Q-H (V),

в якій

Z і Q мають значення які вказані вище,

реакція проходить при необхідності в присутності розчинника, при необхідності в присутності кислотного акцептора і при необхідності в присутності каталізатора.

Нарешті було знайдено, що нові галогенпіримідини загальної формули (I) виявляють дуже сильну фунгіцидну активність.

Сполуки, згідно винаходу, можуть при необхідності використовуватись у вигляді сумішей різних можливих ізомерних форм, переважно в формі -стереоізомерів, як наприклад E- і Z-ізомери. Так використовують як E- так і Z-ізомери, а також будь-які суміші цих-ізомерів.

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

Z означає циклоалкіл з 3-7 атомами вуглецю, незаміщений або заміщений в одному або двох положеннях галогеном, алкілом або гідроксилем;

означає гетероциклі з кількістю ланцюгів від 3 до 7, при необхідності заміщений алкілом з 1-4 атомами вуглецю;

або означає незаміщений або заміщений однаково або різно в від одного до чотирьох положеннях феніл або нафтил, при чому можливі замісники вибрані переважно із перелічених нижче:

галоген, ціан, нітро, зміно, гідрокси, форміл, карбокси, карбамоїл, тіокарбамоїл;

прямолінійний або розгалужений алкіл, гідроксиалкіл, оксоалкіл, алкокси, апоксиалкіл, алкілтіоалкіл, діалкоксиалкіл, алкілтіо, алкілсульфініл або алкілсульфоніл з кількістю атомів вуглецю від 1 до 8;

прямолінійний або розгалужений алкеніл або алкенілокси з кількістю атомів вуглецю від 2 до 6;

прямолінійний або розгалужений галогеналкіл, галогеналкокси, галогеналкілтіо, галогеналкілсульфініл або галогеналкілсульфоніл з кількістю атомів вуглецю від 1 до 6 і з кількістю від 1 до 13 однаковими або різними атомами галогену;

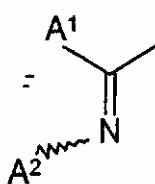
прямолінійний або розгалужений галогеналкіл або галогеналкенілокси з кількістю атомів вуглецю від 2 до 6 і з кількістю від 1 до 11 однаковими або різними атомами галогену;

прямолінійний або розгалужений алкіламіно, діалкіламіно, алкілкарбоніл, алкілкарбонілокси, алкоксикарбоніл, алкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбоніл, арилалкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбонілокси,

алкенілкарбоніл або алкінілкарбоніл з кількістю атомів вуглецю від 1 до 6 у відповідних вуглеводневих ланцюгах;

циклоалкіл або циклоалкілокси з кількістю атомів вуглецю від 3 до 6; двічі приєднанні алкілен з кількістю атомів вуглецю 3 або 4, оксиалкілен з кількістю атомів вуглецю 2 або 3 або діоксиалкілен з кількістю атомів вуглецю 1 або 2, які незаміщений або заміщений в від одного до чотирьох положеннях однаково або різно фтором, хлором, оксогрупою, метилом, трифторметилом або етилом;

або група



в якій

A¹ означає водень, гідроксигрупу або алкіл з кількістю атомів вуглецю від 1 до 4 або циклоалкіл з кількістю атомів вуглецю від 1 до 6 і

A² означає гідроксигрупу, аміногрупу, метиламіногрупу, феніл, бензил або означає алкіл або алкокси з кількістю атомів вуглецю від 1 до 4 незаміщений чи заміщений ціаногрупою, гідроксигрупою, алкоксигрупою, алкілтіогрупою, алкіламіногрупою, діалкіламіногрупою або фенілом або означає алкенілокси або алкінілокси з кількістю атомів вуглецю від 2 до 4,

а також феніл, фенокси, фенілтіо, бензоїл, бензоїлетеніл, ціннамоїл, гетероцикліл або фенілалкіл, фенілалкокси, фенілалкілтіо, або гетероциклілалкіл з кількістю атомів вуглецю від 1 до 3 в кожній алкільній частині, до того ж цикл в кожному випадку незаміщений або заміщений в від одного до трьох положеннях галогеном і/або прямолінійним чи розгалуженим алкілом або алкоксигрупою з кількістю атомів вуглецю від 1 до 4,

R означає водень або метил,

Q означає кисень або сірку,

X означає фтор, хлор, бром або йод і

L¹, L², L³ і L⁴ однакові або різні і, означають незалежно один від одного водень, галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, незаміщені або заміщені від 1 до 5 атомами галогену алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл або алкілсульфоніл з кількістю атомів вуглецю від 1 до 6.

Винахід стосується переважно сполук формули (I), в якій

Z означає незаміщений або заміщений в одному або двох положеннях фтором, хлором, метилом, етилом або гідроксигрупою циклопентил або циклогексил;

незаміщений або заміщений метилом або етилом тіеніл, піридил або фурил;

або незаміщений чи заміщений однаково або різно в від одного до чотирьох положеннях феніл або нафтил, при чому можливі замісники вибрані переважно із перелічених нижче: *

фтор, хлор, бром, йод, ціано, нітро, зміно, гідрокси, форміл, карбокси, карбамоїл, тіокарбамоїл, метил, етил, n- або ізо-пропіл, n-, ізо-, втор- або трет-бутил, 1-, 2-, 3-, неопентил, 1-, 2-, 3-, 4-(2-метилбутил), 1-, 2-, 3-гексил, 1-, 2-, 3-, 4-, 5-(2-метилпентил), 1-, 2-, 3-(3-метилпентил), 2-етилбутил, 1-, 3-, 4-(2, 2-диметилбутил), 1-, 2-(2,3-диметилбутил), гідроксиметил, гідроксиетил, 3-оксобутил, метоксиметил, диметоксиметил,

метокси, етокси, n- або ізо-пропіокси,

метилтіо, етилтіо, n- або ізо-пропілтіо, метилсульфініл, етил сул ьфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл,

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

трифторметил, трифторетил,

дифторметокси, трифторметокси, дифторхлорметокси, трифторетокси, дифторметилтіо, трифторметилтіо, дифторхлорметилтіо, трифторметилсульфініл або трифторметилсульфоніл,

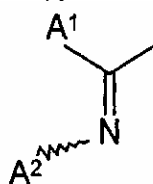
метиламіне, етиламіно, n- або ізо-пропіламіно, диметиламіне, диетиламіно,

ацетил, пропіоніл, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, метиламінокарбоніл, етиламінокарбоніл, диметиламінокарбоніл, диетиламінокарбоніл, диметиламінокарбонілокси, диетиламінокарбонілокси, бензиламінокарбоніл, акроїл, пропіолоїл,

циклопентил, циклогексил,

двічі приєднанні пропандііл, етиленокси-, метилендіокси-, етилендіоксигрупа незаміщена або заміщена однаково або різно в від одного до чотирьох положеннях фтором, хлором, оксогрупою, метилом або трифторметилом,

або група



в якій

A¹ означає водень, метил або гідроксигрупу і

A² означає гідроксигрупу, метоксигрупу, етоксигрупу, аміногрупу, метиламіногрупу, феніл, бензил або гідроксиетил, а також

незаміщений або заміщений в кільці в від одного до трьох положеннях галогеном і/або прямим чи розгалуженим алкілом або алкоксигрупою з кількістю атомів вуглецю від 1 до 4, феніл, фенокси, фенілтіо, бензоїл, бензоїлетеніл, ціннамоїл, бензил, фенілетил, фенілпропіл, бензидокси, бензилтіо, 5,6-дигідро-1,4,2-диоксазин-3-ілметил, триазоліл-метил, бензаксазол-2-ілметил, 1,3-диоксан-2-іл, бензімідазол-2-іл, диоксол-2-іл, оксодіазоліл,

R означає водень або, переважно метил,

Q означає кисень або сірку,

X означає фтор або хлор, і

L¹, L², L³ і L⁴ однакові або різні і, незалежно один від одного означають водень, фтор, хлор, бром, ціаногрупу, нітрогрупу, метил, етил, n- або ізо-пропіл, n-, ізо-, втор- або трет-бутил, метокси, етокси, n- або ізо-пропіл-окси, метилтіо, етилтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл, трифторметил, трифторетил, дифторметокси, трифторметокси, дифторхлорметокси, трифторетокси, дифторметолтіо, дифторхлорметилтіо, трифторметилтіо, трифторметилсульфініл або трифторметилсульфоніл.

В цілому більш переважають групи сполук в яких Z означає незаміщений або заміщений феніл. Надалі в цілому більш переважають групи сполук в яких L^1 і L^3 означають незалежно один від одного метил і, переважно водень і, L^2 і L^4 означають водень.

Більш переважають сполуки формули (I) в яких X переважно означає фтор.

Вищенаведені загальні або переважні області вказаних визначених радикалів дійсні як для кінцевих продуктів формули (I), так і відповідно для потрібних вихідних речовин і проміжних продуктів.

Будь які, відповідно, переважні комбінації радикалів, що наведені в описі радикалів можуть бути, незалежно від наведених комбінацій радикалів, замінені довільно, виходячи із опису радикалів для інших переважних галузей застосування.

Ці визначені радикали можна комбінувати між собою будь-як, а також між вказаними ділянками для переважних сполук.

Для проведення способу а) згідно винаходу в якості вихідної речовини необхідно брати 2-(2-гідроксифеніл)-2-метоксиіміно-ацетамід формули (II). В цій формулі (II) радикали R, L^1 , L^2 , L^3 і L^4 переважно мають значення, які вже відомі з опису сполук згідно винаходу формули (I), як переважні або інакше більш переважні для R, L^1 , L^2 , L^3 і L^4 .

Вихідні речовини формули (II) вже відомі і можуть бути одержані відомими способами (порівняти, наприклад, WO - A 9524396).

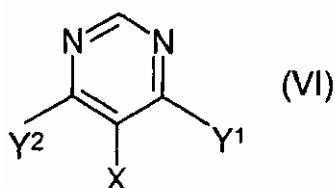
Для проведення способу а) згідно винаходу надалі в якості вихідної речовини необхідно брати галогенпіримідин формули (III). В цій формулі (III) радикали Z, Q і X переважно мають значення, які вже відомі з опису сполук згідно винаходу формули (I), як переважні або інакше більш переважні. Y^1 означає галоген, переважно фтор або хлор.

Вихідні речовини формули (III) вже відомі і можуть бути одержані відомими методами (порівняти, наприклад, DE-A 4340181; Chem.Ber., 90 <1957>942, 951).

Для проведення способу б) згідно винаходу в якості вихідної речовини необхідно брати феноксіпіримідин загальної формули (IV). В цій формулі (IV) радикали R, X, L^1 , L^2 , L^3 і L^4 переважно мають значення, які вже відомі з опису сполук згідно винаходу формули (I), як переважні або інакше більш переважні для R, X, L^1 , L^2 , L^3 і L^4 . Y^2 означає галоген, переважно фтор або хлор.

Вихідні речовини формули (IV) є новими і також є предметом даного винаходу.

Феноксіпіримідини загальної формули (IV) одержують (спосіб 6-1) коли 2-(2-гідроксифеніл)-2-метоксиіміноацетамід формули (II) взаємодіє з тригалогенпіримідином загальної формули (VI)



в якій

X, Y^1 і Y^2 однакові або різні і означають галоген, при необхідності, в присутності акцептора кислоти і при необхідності в присутності каталізатора.

Для проведення способу б-1), згідно винаходу, в якості вихідної речовини необхідно брати тригалогенпіримідин загальної формули (VI). В цій формулі (VI) радикали X, Y^1 і Y^2 означають галоген, переважно фтор або хлор.

Тригалогенпіримідини вже відомі і можуть бути одержані відомими методами (порівняти, наприклад, Chesterfield et al., J. Chem. Soc., 1955; 3478, 3480).

Надалі для проведення способу б), згідно винаходу, в якості вихідної речовини необхідно брати циклічні сполуки загальної формули (V). В цій формулі (V) радикали Z і Q переважно мають значення, які вже відомі з опису сполук згідно винаходу формули (I), як переважні або, інакше, більш переважні для Z і Q.

Циклічні сполуки формули (V) є відомими хімікатами для синтезу і/або можуть бути одержані простими методами.

В якості розчинника для проведення способів а), б) і б-1), згідно винаходу, беруть до уваги будь-які інертні органічні розчинники. Для цього необхідно брати переважно етер такий, як диетилетер, діізопропілетер, метил-трет-бутилетер, диоксан, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксиетан, 1,2-диетоксиетан або анізол; нітрil такий, як ацетонітрil, пропіонітрil, n- або ізо-бутиронітрil або бензонітрil; амil такий, як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метилформамід, N-метилформамід, N-метилпіролідон або триамід гексаметилфосфорної кислоти; сульфоксид такий, як диметилсульфоксид; або сульфон такий, як сульфолан.

Способи а), б) і б-1), згідно винаходу, проводять при необхідності в присутності придатного акцептора кислоти. В якості таких придатні всі загальноновживані неорганічні або органічні основи. Для цього необхідно брати гідриди, гідроксиди, алкоголяти, карбонати або гідрогенкарбонати лужних або лужноземельних металів такі, як наприклад гідрид натрію, амід натрію, третбутират калію, гідроксид натрію, гідроксид калію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрогенкарбонат калію або гідрогенкарбонат натрію.

В якості каталізаторів для способів а), б) і б-1), згідно винаходу, придатні всі солі одновалентної міді такі, як, наприклад, хлорид одновалентної міді, бромід одновалентної міді або йодид одновалентної міді.

Температура реакції при проведенні способів а), б) і б-1), згідно винаходу, може варіювати у великих межах. Як правило, працюють при температурах від -20°C до 100°C, більш переважно, при температурах від 10°C до 80°C.

Для проведення способу а), згідно винаходу, щоб одержати сполуки формули (I) використовують на один моль 2-(2-гідрокси-феніл)-2-метоксиіміноацетаміду формули (II), як правило, від 0,5 до 15моль, переважно від

0,8 до 8моль заміщеного галогенпіримідину формули (III).

Для проведення способу б), згідно винаходу, щоб одержати сполуки формули (I) використовують на один моль феноксіпіримідину формули (IV), як правило, від 0,5 до 15моль, переважно від 0,8 до 8моль циклічної сполуки загальної формули (V).

Для проведення способу б-1), згідно винаходу, щоб одержати сполуки формули (IV) використовують на один моль 2-(2-гідрокси-феніл)-2-метоксіміноацетаміду формули (II), як правило, від 1 до 15моль, переважно від 2 до 8моль тригалогенпіримідину загальної формули (VI).

Всі способи, згідно винаходу, проводять, як правило, при нормальному тиску. Але, все-таки, також можливо працювати при збільшеному або зменшеному тиску в інтервалі від 0,1бар до 10бар.

Проведення реакції, переробка і виділення продуктів реакції здійснюють загальновідомими способами (порівняти також приклади одержання речовин).

Речовини, згідно винаходу, показують сильну мікробіцидну активність і можуть бути використанні для боротьби з небажаними мікроорганізмами, такими, як грибки і бактерії при захисті рослин і при захисті матеріалів.

Фунгіциди використовують при захисті рослин для боротьби з Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes і Deuteromycetes.

Бактерициди використовують при захисті рослин для боротьби з Psseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae і Streptomycetaceae.

Як приклад можна привести деякі збудники грибкових і бактеріальних захворювань, але не обмежуючись ними, які підпадають під вищенаведені поняття:

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

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

вид *Erwinia*, як наприклад *Erwinia amylovora*;

вид *Pythium*, як наприклад *Pythium ultimum*;

вид *Phytophthora*, як наприклад *Phytophthora infestans*;

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

вид *Plasmopara*, як наприклад *Plasmopara viticola*;

вид *Bremia*, як наприклад *Bremia lactucae*;

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

вид *Erysiphe*, як наприклад *Erysiphe graminis*;

вид *Sphaeroteca*, як наприклад *Sphaeroteca fuliginea*;

вид *Podosphaera*, як наприклад *Podosphaera leucotricha*;

вид *Venturia*, як наприклад *Venturia inaequalis*;

вид *Pyrenophora*, як наприклад *Pyrenophora teres* або *P. graminea* (Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);

вид *Cochliobolus*, як наприклад *Cochliobolus sativus* (Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);

вид *Uromyces*, як наприклад *Uromyces appendiculatus*;

вид *Puccinia*, як наприклад *Puccinia recondita*;

вид *Sclerotinia*, як наприклад *Sclerotinia sclerotiorum*;

вид *Tilletia*, як наприклад *Tilletia caries*;

вид *Ustilago*, як наприклад *Ustilago nuda* або *Ustilago avenae*;

вид *Pellicularia*, як наприклад *Pellicularia sasakii*;

вид *Pyricularia*, як наприклад *Pyricularia oryzae*;

вид *Fusarium*, як наприклад *Fusarium culmorum*;

вид *Botrytis*, як наприклад *Botrytis cinerea*;

вид *Septoria*, як наприклад *Septoria nodorum*;

вид *Leptosphaeria*, як наприклад *Leptosphaeria nodorum*;

вид *Cercospora*, як наприклад *Cercospora canescens*;

вид *Alternaria*, як наприклад *Alternaria brassicae*;

вид *Pseudocercospora*, як наприклад *Pseudocercospora herpotrichoides*.

Добра переносимість рослинами активних речовин в концентраціях, необхідних для боротьби з хворобами рослин, дозволяє обробку наземних частин рослин, розсади і насіння і ґрунту.

При цьому є можливість використовувати активні речовини, згідно винаходу, досягаючи особливо добрих результатів при боротьбі з хворобами зернових культур, наприклад при боротьбі з такими видами, як *Erysiphe*, *Puccinia*, *Fusarium* і *Pyrenophora*, для боротьби з хворобами у виноградарстві, садівництві та овочівництві, наприклад при боротьбі з такими видами, як наприклад *Venturia*, *Sphaeroteca* і *Plasmopara*, *Phytophthora* або для боротьби з хворобами рису, наприклад при боротьбі з такими видами, як *Pyricularia*. Добрих результатів досягають також при боротьбі з хворобами зернових культур, наприклад при боротьбі з такими видами як, *Septoria*, *Pyrenophora* або *Cochliobolus*. Подальші використання сполук, згідно винаходу, також приводить до збільшення урожайності культурних рослин.

Активні речовини можуть, в залежності від їх відповідних фізичних і/або хімічних властивостей, переводитись в загальноприйнятні форми використання такі, як розчини, емульсії, суспензії, порошки, піни, пасти, гранули, аерозолі, мілкі капсули в полімерних речовинах, покривних масах для посівного матеріалу, а також форми дуже малих об'ємів для створення холодного і теплого туману.

Ці форми застосування виготовлялись відомим способом, наприклад, змішуванням активних речовин з нейтральним наповнювачем, отже рідкими розчинниками під тиском стоячих зріджених газів і/або твердих речовин носіїв у випадку необхідності при застосуванні поверхнево-активних засобів, відповідно емульгуючих і/або диспергуючих і/або піноутворюючих засобів. У випадку використання води, як нейтрального наповнювача можна наприклад застосовувати також органічний розчинник в якості додаткового розчинника. В якості рідкого розчинника в основному беруть: ароматичні такі, як ксилол, толуол або алкіл нафталін, хлоровані ароматичні

або хлоровані аліфатичні вуглеводи такі, як хлорбензол, хлоретилен або метиленхлорид, аліфатичні вуглеводи такі, як циклогексан або парафіни, наприклад фракції нафта, спирти такі, як бутанол або гліколь, а також етери і естери, кетони такі, як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон або циклогексанон, дуже полярні розчинники такі, як диметилформамід і диметилсульфоксид, а також воду. Звичайні зріджені газоподібні нейтральні наповнювачі або речовини носії це такі рідини, які при нормальній температурі і нормальному тиску газоподібні, наприклад газ, вспінюючі аерозоль такі, як галогенвуглеводні, а також бутан, пропан, азот і діоксид вуглецю. В якості твердих речовин-носіїв беруть: наприклад, тонкоподрібнену гірську породу таку, як каолін, глинозем, тальк, крейда, кварц, атапульгіт, монтморілоніт, або діатоміт і синтетичну тонкоподрібнену породу таку як вискодиспергована кремнієва кислота, оксид алюмінію і силікат. В якості твердих речовин-носіїв для гранулята беруть: наприклад, подрібнене і фракціоноване природне каміння таке як кальцит, мрамур, пемза, сепіоліт, доломіт, а також синтетичний гранулят із неорганічного і органічного борошна, а також гранулят із змелених органічних матеріалів таких, як стружки, шкаралупа кокосового горіха, качан кукурудзи і стебла тютюну. В якості емульгатора і/або піноутворюючого засобу беруть: наприклад, неіоногенні і аніонні емульгатори такі, як поліоксиетиленовий естер жирних кислот, поліоксиетиленовий етер вищих спиртів наприклад, алкіларилполігліколевий етер, алкілсульфонат, алкілсульфат, арилсульфонат, а також гідролізати яєчного білка. В якості диспергуючого засоба беруть: наприклад, лігнін-сульфітний відпрацьований луг і метилцелюлозу.

Приготовлені форми можуть містити в якості засобів покращуючих адгезію карбоксиметилцелюлозу, природні і синтетичні порошкоподібні, зернисті або латексної форми полімери такі, як гуміарабік, полівініловий спирт, полівінілацетат, а також природні фосфоліпіди такі, як кефалін і лецитин, і синтетичні фосфоліпіди. Можуть бути також додані мінеральні і рослинні масла.

Можна застосовувати в якості барвників органічні пігменти наприклад, оксид заліза, оксид титану, ціан заліза синій і органічні фарбуючі речовини такі як алізарин-, азо- і металфталоцианінові барвники і мікроелементи такі, як солі заліза, марганцю, бору, міді, кобальту, молібдену і цинку.

Форми застосування містять, як правило, між 0,1 в 95 вагових процентів активної речовини, переважно між 0,5 і 90%.

Активна речовина, згідно винаходу, може міститись у приготовлених формах як самостійно, так і в сумішах з відомими фунгіцидами, бактерицидами, акарицидами, нематицидами або інсектицидами для того, наприклад, щоб, розширити спектр дії і запобігти стійкості до них. В багатьох випадках отримують при цьому, синергетичний ефект, тобто ефективність суміші більша ніж ефективність окремих компонентів.

В якості примішуваних речовин, мова йде наприклад, про такі сполуки: фунгіциди:

алдіморф, ампропілфос, ампропілфос-калій, андопрім, анілазін, ацаконазол, ацоксістробін, беналаксіл, беноданіл, беноміл, бензамакріл, бензамакріл-ізобутил, біалафос, бінапакріл, біфеніл, бітертанол, бластикдін-S, бромукназол, бупірімат, бутіобат, полісульфід кальцію, карсіміцин, картафол, картан, карбендазим, карбоксин, карфон, хінометіонат (квінометіонат), хлорбентіазол, хлорфеназол, хлоронеб, хлоропікрин, хлороталоніл, хлосолінат, клоцілакон, куфранеб, кумоксаніл, купрокназол, купродиніл, купрофурам, дебакарб, дихлорофен, дихлобутразол, дихлофлуанід, дихломецин, дихлоран, диетофенкарб, дифеноконазол, диметиріомол, диметоморф, диніконазол, диніконазол-М, динокап, дифеніламін, дипіритіон, диталіамфос, дитіанон, додеморф, додін, дразоксолон, епідерфос, епоксіконазол, етаконазол, етірімол, етрідіазол, фамоксадон, фенапаніл, фенаріомол, фенбуконазол, фенфурам, фенітропан, фенпіхлоніл, фенпропідин, фенпропіморф, фентінацетат, фентінгідроксид, фебрам, ферімзон, флуазінам, флуметофор, фторомід, флуквінказол, флурпрімідол, флусілазол, флусульамід, флутоланіл, флутріафол, фолпет, фозетіл-алюміній, фозетіл-натрій, фталід, фуберідазол, фуралаксіл, фураметрил, фуркарбоніл, фурконазол, фурконазол-цис, фурумециклокс, гуазатін, гексахлоробензол, гексиконазол, гумексазол, імізаліл, імібенконазол, іміноктадін, іміноктадінальбезілат, іміноктадінітриацетат, йодокарб, інконазол, іпробенфос (IBP), іпродіон, ірумаціцин, ізопротіолан, ізоваледін, казугаміцин, кресоксим-метил, сполуки міді такі як: гідроксид міді, нафтенат міді, оксихлорид міді, сульфат міді, оксид міді, оксин міді і бордоська суміш, манкопер, манкозеб, манеб, меферімзоле, мепаніпурім, мепроніл, металаксіл, метконазол, метасульфоккарб, метфуроксам, метирам, метомеклам, метсульфовакс, мільдіоміцин, муклобутаніл, муклозолін, диметилдитіокарбамат нікелю, нітротал-ізопропіл, нуаріомол, офураце, оксидиксіл, оксомокарб, оксолінікацид, оксикарбоксим, оксифентіін, паклобутразол, пefуразоат, пенконазол, пенцикурон, фосдифен, пімаріцин, піпералін, поліоксін, поліоксорім, пробеназол, прохлораз, прокумідон, пропамоккарб, пропанозим-натрій, пропіконазол, пропінеб, піразофос, піріфенокс, піріметаніл, піроквілон, піроксифур, квінконазол, квінтоцен (PCNB), сірка і сполуки сірки, тебуконазол, теклофталат, текназен, тетциклакіс, тетраконазол, тіабендазол, тіціофен, тифлузамід, тіофанате-метил, тірам, тіоксимід, толхлофос-метил, толілфлуанід, триадімефон, триадіменол, триазбутил, триазоксид, трициклазол, тридеморф, трифлумізол, трифорін, тритіконазол, уніконазол, валідаміцин А, вінхлосалін, вініконазол, царіламід, цінеб, цирам, а також дагер D, ОК-8705, ОК-8801,

α-(1,1-диметилетил)-β-(2-феноксietил)-1Н-1,2,4-триазол-1-етанол,

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

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

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

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

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

1-ізопропіловий естер {2-метил-1-[[[1 (4метилфеніл)етил]аміно]карбоніл]пропіл]-карбамінової кислоти,

α-(2,4-дихлорфеніл)-2-(1Н-1,2,4-триазол-1-іл)етанол-О-(фенілметил)-оксим,

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

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

1-[дйодметил]-сульфоніл]-4-метил-бензол,

1-[[2-(2,4-дихлорфеніл)-1,3-диоксолан-2-іл]-метил]-1Н-імідазол,

1-[[2-(2,4-хлорфеніл)-3фенілоксораніл]-метил]-1Н-1,2,4-триазол,

1-[1-[2-[(2,4-дихлорфеніл)метокси]феніл]етеніл]-1 Н-імідазол,
 1-метил-5-ноніл-2-(фенілметил)-3-піролідинол,
 2,6'-дибром-2-метил-4'-трифторметил-4'-трифторметил-1,3-триазол-5-карбоксанілід,
 2,2-дихлор-N-[1-(4-хлорфеніл)етил]-1-етил-3-метил-циклопропанкарбоксамід,
 2,6-дихлор-5-(метилтіо)-4-піримідинілттриоксианат,
 2,2-дихлор-N-(4-трифторметилбензил)-бензамід,
 2,2-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-триадіазол,
 2-[[6-деокси-4-О-(4-О-метил-β-D-глікопіранозіл)-α-D-глікопіранозіл]-аміно]-4-метокси-1Н-піроло[2,3']піримідин-5-карбонітріл,
 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-диметилфент)-N-(ізотіоціанатометил)-ацетамід,
 2-фенілфенол (ОРР)
 3,4-дихлор-1-[4-(дифторметокси)-феніл]-1 Н-пірол-2,5-діон,
 3,4-дихлор-N-[[циан[(1-метил-2-пропініл)окси]метил]-бензамід,
 3-(1,1-диметилпропіл-1-оксо-1 Н-інден-2-карбонітріл,
 3-[2-(4-хлорфеніл)-5-етокси-3-ізоксалідиніл]-піридин,
 4-хлор-2-циан-N,N-диметил-5-(4-метилфеніл)-1Н-імідазол-1-сульфонамід,
 4-метил-тетразоло[1,5-а]пентазолін-5(4Н)-он,
 8-(1,1-диметилетил)-N-етил-N-пропіл-1,4-диоксаспіро[4.5]декан-2-метанаміно,
 8-гідроксигінолілсульфат,
 2-[(феніламіно)-карбоніл]-гідразид 9Н-ксантен-9-карбонової кислоти,
 біс-(1-метилетил)-3-метил-4-[(3-метилбензоїл)окси]-2,5-тіофендикарбоксилат,
 цис-1-(4-хлорфеніл)-2-(1Н-1,2,4-триазол-1-іл)-циклогептанол,
 цис-4-[3-[4-(1,1-диметилпропіл)-феніл-2-метилпропіл]-2,6-диметил-морфолін-гідрохлорид,
 етил-[(4-хлорфеніл)-азо]-ціаноацетат,
 гідрогенкарбонат калію,
 метантетратіол, -сіль натрію,
 метил-1-(2,3-дигідро-2,2-диметил-1Н-інден-1-іл)-1Н-імідазол-5-карбоксилат,
 метил-N-(2,6-диметилфент)-N-(5-130Ксазолткарбонш)-01-аланін'нат,
 N-(2,3-дихлор-4-гідроксифеніл)-1-метил-циклогексанкарбоксамід,
 N-(2,6-диметилфеніл)-2-метокси-N-(тетрагідро-2-оксо-3-фураніл)-ацетамід,
 N-(2,6-диметилфеніл)-2-метокси-N-(тетрагідро-2-оксо-3-тіеніл)-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-оксолідиніл)-ацетамід,
 N-(6-метокси)-3-піридиніл)-циклопропанкарбоксамід,
 N-[2,2,2-трихлор-1-[(хлорацетат)-аміно]-етил]-бензамід,
 N-[3-хлор-4,5-біс(2-пропінілокси)-феніл]-N'-метокси-метанімідамід,
 N-форміл-N-гідрокси-DL-аланін, -сіль натрію,
 О,О-диетил-[2-(дипропіламіно)-2-оксоетил]-етилфосфорамідотіоат,
 О-метил-S-феніл-фенілпропілфосфорамідотіоат,
 S-метил-1,2,3-бензотіадиазол-7-карботіоат,
 спіро[2Н]-1-бензопіран-2,1'(3'Н)-ізобензофуран]-3'-он.

Бактерициди:

бромопол, дихлорофен, нітрапірин, диметилдитіокарбамат нікелю, касугаміцин, октилінон, фуранкарбонова кислота, оксатетрациклін, пробеназол, стрептоміцин, теклофталат, сульфат міді і інші сполуки, що містять мідь.

Інсектициди (акарициди) нематодциди:

абамектин, ацефат, акрінатрін, аланіфарб, алдикарб, алфаметрин, амітраз, афермектин, AZ 60541, азадирахтин, азинфос А, азинфос М, азоциклотін, *Bacillus thuringiensis*, 4-бром-2-(4-хлорфеніл)-1-(етоксиметил)-5-(трифторметил)-1Н-пірол-3-карбонітріл, бендіокарб, бенферакарб, бенсультаб, бетацифлутрін, біфентріл, ВРМС, брофенпрокс, бромфос А, буфенкарб, бупрофезин, бутіокарбоксин, бутілпуридабен, кадусафос, карбаріл, карбофуран, карбофенотіон, карбосульфат, картап.хлоретоксифос, хлорфенапір, хлорфенфінфос, хлорфлуацирон, хлормефос, N-[(6-хлор-3-піридиніл)-метил]-N'-ціано-N-метилетанімідамід, хлорпірифос, хлорпірифос М, цис-резметрін, клоцитрін, клофентизін, цианофос, циклопропіл, цифлутрін, циклопропіл, цихексатін, циперметрін, циромазін, дельтаметрін, деметон М, деметон S, деметон-S-метил, діафентіурон, диазінон, дихлофентіон, дихлофос, дикліфос, дихротифос, диетіон, дифлубензурон, диметоат, диметилфінфос, диоксатіон, дисульфотон, едіфенфос, емаметкін, есфенвалерат, етіофенкарб.етіон, етофенпрокс, етопрофос, фенаміфос, феназаквін, фенбутатіноксид, фенітротіон, фенобукарб, фенотіокарб, феноксикарб, фенпропатрін, фенпурад, фенпуроксимат, фентіон, фенвалерат, фіпроніл, флуазінам, флуазурон, флуциклоксирон, флуцитрінат, флуфеноксирон, флуфенпрокс, НСН, гептенофос, гексафлумурон, гекситіазокс, Імідаклопід, іпробенфос, ізацфос, ізофенфос, ізопрокарб, ізоксатіон, іфермектін, ламда-цугалотрін, луфенурол, малатіон, мекарбам, мерфінфос, месьульфенфос, метальдегід, метакріфос, метамідофос, метідатіон, метіокарб, метоміл, метолкарб, мельбемектін, монокротофос, моксідектін, налед, NC 184, нітенпурам, ометоат, оксаміл, оксидеметон М, оксидепрофос,

паратіон А, паратіон М, перметрін, фентоат, форат, фосалон, фосмет, фосфамідон, фоксім, пірімікарб, піріміфос М, піріміфосА, профенофос, промекарб, пропафос, пропоксір, протіофос, протоат, піметрозин, пірахлофос, пірідафентіон, піресметрін, піретрум, пірідабен, пірімідіфен, піріпроксифен, квінальфос, салітіон, себуфос, сілафйлуофен, сульфотеп, сульпрофос, тебуфенозід, тебуфенпірад, тебупірімфос, тефлубензурон, тефлутрін, темефос, тербам, тербуфос, тетрахлорфінфос, тіафенокс, тіодикарб, тіофанокс, тіометон, тіоназін, турінгінзін, тралометрін, триаратен, триазофос, триазофос, триазурон, трихлорфон, трифлумірон, триметакарб, фамідотіон, ХМС, ксилілкарб, зетаметрін.

Також можливе змішування з іншими відомих активних речовин, можливо такими, як гербіциди або добрива і регулятори росту.

Активні речовини можуть застосовуватись в їх товарних формах або у вигляді приготовлених з цього форм застосування такі, які готові до використання, це розчини, суспензії, порошки для розпилення, пасти, розчинні порошки, порошок і гранули. Застосування проводять загальновідомими способами, наприклад поливання, розбрыкування, розсипання, розпіння, обмашування та інші. Також можливо, що активні речовини вносять у форми приготовленого із дуже малих об'ємів холодного або гарячого туману, або що

форми активної речовини, готові для використання, або саму активну речовину вносять в ґрунт, їх також можливо використовувати для обробки насіння рослин.

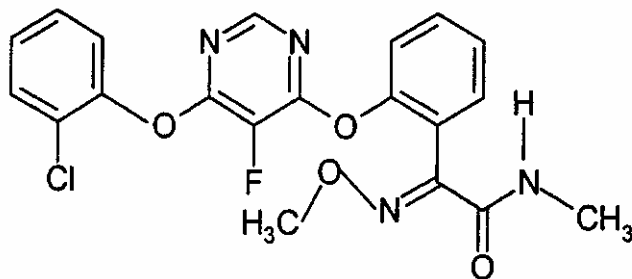
При обробці частин рослин можна варіювати концентраціями активної речовини приготовленої в формах придатних для застосування в великих межах: вони лежать, як правило, між 1 і 0,0001ваг.%, переважно між 0,5 і 0,001ваг.%.

При обробці насіння використовують, як правило, від 0,001г до 50г активної речовини на кожен кілограм насіння, переважно від 0,01г до 10г.

При обробці ґрунту використовують концентрації активних речовин від 0,00001 до 0,1ваг.%, переважно від 0,0001 до 0,02ваг.% на місце дії.

Приклади одержання:

Приклад 1

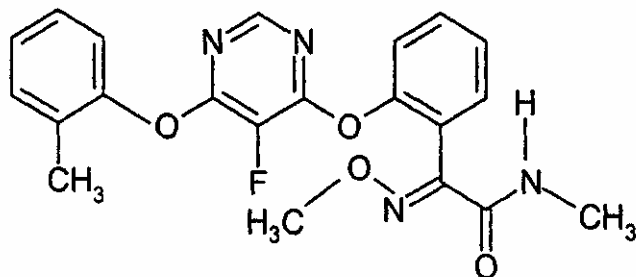


спосіб а)

До суміші, яка складається із 2г (0,0096моль) 2-(2-гідрокси-феніл)-2-метоксиіміно-N-метилацетаміду і 2,3г (0,0095моль) 4-(2-хлорфенокси)5,6-дифторпіримідину в диметилформаміді додають при охолодженні 0,4г (0,01моль) 60%-ного гідриду натрію і перемішують протягом 12 годин при 25°C. Виливають реакційну суміш у воду, екстрагують дихлорметаном, висушують органічну фазу над сульфатом натрію і відганяють розчинник у вакуумі. Проводять хроматографію залишку сумішшю із рівних об'ємів етилового естера оцтової кислоти і циклогексану на силікагелі. Одержують 2,1г (48,3% від теорії) 2-(2-(6-(2-хлорфенокси)-5-фторпіримідин-4-ілокси)-феніл)-2-метоксиіміно-N-метилацетаміду.

¹H-ЯМР-спектр (CDCl₃/TMS): δ = 2,88/2,90 (3H); 3,82 (3H); 6,68 (1H); 7,25-7,54 (8H); 8,05 (1H)м.ч.

Приклад 2



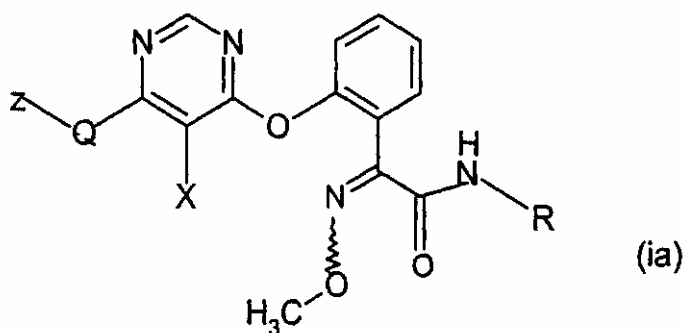
спосіб б)

До суміші, яка складається із 2г (0,0062моль) 2-(2-(5,6-дифторпіримідин-4-ілокси)-феніл)-2-метоксиіміно-N-метилацетаміду і 0,67г - (0,0062моль) 2-метилфенолу в 2мл диметилформаміді додають при охолодженні 0,25г (0,0062моль) 60%-ного гідриду натрію і перемішують протягом 12 годин при 25°C. Виливають реакційну суміш у воду, екстрагують етиловим естером оцтової кислоти, висушують органічну фазу над сульфатом натрію і відганяють розчинник у вакуумі. Одержують 1,5г (58,9% від теорії) 2-(2-(5-фтор-6-о-толтоксипіримідин-4-ілокси)-феніл)-2-метоксиіміно-N-метилацетаміду.

¹H-ЯМР-спектр (COCl₂/DMF): δ = 2,21 (3H); 2,89/2,90 (3H); 3,84 (3H); 6,7 (1H,в); 7,06-7,53 (8H); 8,06 (1H) м.ч.

Аналогічно прикладам 1-2, а також згідно з даними наведеними в загальному описі методу одержання, були одержані сполуки формулі (Ia), які наведені нижче в таблиці 1.

Таблиця 1:



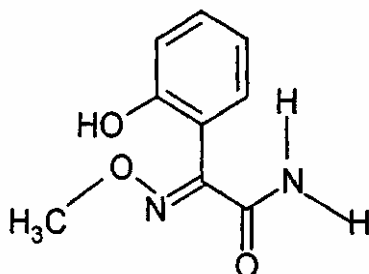
№ прикладу	R	Q	X	R	Темп. пл.(°C)	ЯМР	Log P
3	феніл	O	F	-CH ₃	107	3,85	2,77
4	2-ціанфеніл	O	F	-CH ₃	128-130	3,85	2,6
5	2-метоксифеніл	O	F	-CH ₃		3,83	2,72
2	2-метилфеніл	O	F	-CH ₃		3,84	3,04
6	4-хлорфеніл	O	F	-CH ₃		3,85	3,22
7	2-ацетилфеніл	O	F	-CH ₃		3,85	2,51
8	2-алілоксифеніл	O	F	-CH ₃		3,82	3,11
9	2-пропіонілоксифеніл	O	F	-CH ₃		3,85	2,83
10	2-хлорфеніл	O	F	-H		3,87	2,79
11	2-бромфеніл	O	F	-CH ₃		3,83	3,08
12	2-фторфеніл	O	F	-CH ₃		3,82	2,85
13	2,4-дибромфеніл	O	F	-CH ₃		3,83	3,76
14	2,3-дихлорфеніл	O	F	-CH ₃		3,83	3,45
15	2,4-дихлорфеніл	O	F	-CH ₃		3,83	3,61
16	2,5-дихлорфеніл	O	F	-CH ₃		3,83	3,53
17	2,6-дихлорфеніл	O	F	-CH ₃		3,79	3,35
18	2,3-диметилфеніл	O	F	-CH ₃		3,77	3,30
19	2,4-диметилфеніл	O	F	-CH ₃		3,84	3,39
20	2,5-диметилфеніл	O	F	-CH ₃		3,76	3,52
21	2, 6-д и метил феніл	O	F	-CH ₃		3,82	3,29
22	2-хлор-4-метилфеніл	O	F	-CH ₃		3,82	3,41
23	2-хлор-5-метилфеніл	O	F	-CH ₃		3,82	3,37
24	3-хлор-2-метилфеніл	O	F	-CH ₃		3,84	3,50
25	4-хлор-2-метилфеніл	O	F	-CH ₃			
26	2-бром-4-хлорфеніл	O	F	-CH ₃		3,83	3,65
27	4-бром-2-хлорфеніл	O	F	-CH ₃		3,82	3,70
28	феніл	S	F	-CH ₃		3,81	3,07

*) ¹H-ЯМР-спектри знімали в дейтерохлороформі (CDCl₃) або в гексадегидродиметилсульфоксиді (DMSO-d₆) з тетраметилсиланом (TMS) в якості внутрішнього стандарту. Хімічні зсуви δ-значень вказані в мільйонних частках.

**) Визначення значення log P було здійснено згідно з директивою ЕЕС 79/831 Annex V. A8 за допомогою HPLC (рідкий хроматограф фірми Хьюлетт-Паккард) градієнтним методом (ацетонітрил/0,1% водна фосфорна кислота).

Одержання вихідних речовин формули (II):

Приклад (II-1):

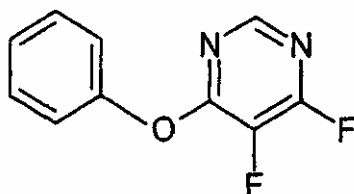


5г (0,028моль) бензофуран-2,3-діон-3-(О-метилоксиму) (WO-A 9524396) перемішують в 100мл тетрагідрофурану з 20мл 25%-ного водного - розчину амоніаку протягом 2 годин при 20°С. Потім відганяють розчинник у вакуумі, виливають залишок у воду- екстрагують етиловим естером оцтової кислоти, висушують органічну фазу над сульфатом натрію і відганяють розчинник у вакуумі. Залишок перекристалізують із етанолу і одержують 2г (36,4% від теорії) 2-(2-гідроксифеніл)-2-метоксиіміноацетаміду. Log p=0,83

GC/MS (газова хроматографія з мас-спектрометричним детектуванням) сілікованої речовини:

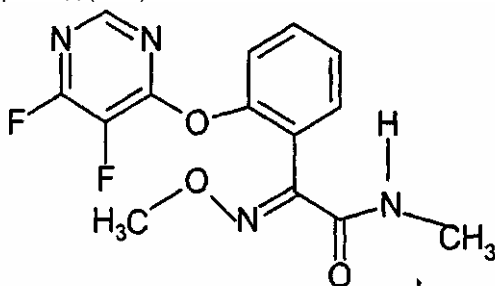
індекс утримування: 1827

Іони, що спостерігають в мас-спектрі: M=341, 323, 307, 291, 149, 133, 192, 176, 135, 116, 89, 73, 45, 26.
Одержання вихідних сполук формули (III)
Приклад (III-1)



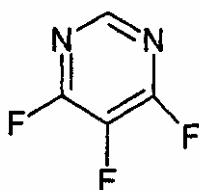
Розчин 42,4г (0,45моль) фенолу і 50,4г (0,45моль) третбутилату калію в 100мл тетрагідрофурану прикапують при 0°C до розчину 80г (0,6моль) 4,5,6-трифторпіримідину в 1л тетрафурану. Потім перемішують протягом 30 хвилин при 0°C, потім виливають реакційну суміш у воду і екстрагували етиловим естером оцтової кислоти. Висушили органічну фазу над сульфатом натрію, відганяють розчинник у вакуумі і перемішують залишок низько киплячим петролевим етером. Отримують 63,8г (68,1% від теорії) 4-фенокси-5,6-дифторпіримідину з температурою плавлення 65-66°C.

Одержання вихідних речовин формули (IV):
Приклад (IV-1)



5г (0,024моль) 2-(2-гідроксифеніл)-2-метоксиіміно-N-метилацетаміду розчиняють в 30мл тетрагідрофурану і охолоджують до 0°C. Додають порціями при перемішуванні 2,7г (0,024моль) третбутирату калію. Одержаний таким чином розчин додають по краплям в розчин 4,5,6-трифторпіримідину в 40мл тетрагідрофурану при 0°C. Після цього перемішують суміш одну годину при 20°C. Потім відганяють розчинник у вакуумі, виливають залишок у воду, екстрагують етиловим естером оцтової кислоти, висушують органічну фазу над сульфатом натрію і відганяють розчин у вакуумі. Після перемішування з диетиленетером відфільтровують 3,2г (41,3% від теорії) кристалічного 2-[2-(5,6-дифторпіримідин-4-ілокси)-феніл]-2-метоксиіміно-N-метилацетаміду.

¹H-ЯМР-спектр (CDCl₃/TMS): δ = 2,87/2,88 (3H); 3,81 (3H); 6,67 (1H,в); 7,33-7,55 (4H); 8,19/8,20 (1H) м.ч.
Одержання вихідного продукту формули (VI)
Приклад (VI-1)



Із суміші 609г фториду калію в 2,3л сульфолані відганяють до висушування 500мл рідини при 145°C і 20 мілібар. Потім додають 1054г 5-хлор-4,6-дифторпіримідину (DE-A 3843558) і 25г тетрафенілфосфонійброміду, створюючи азотом тиск 5 бар і 24 години перемішують при 240°C, при чому тиск піднімається до 11 бар. Реакційну суміш охолоджують до 80°C і послаблюють тиск. Тепер суміш знову повільно нагрівають при нормальному тиску; при цьому продукт відганяють. Досягаючи температури кубового залишку 200°C, зменшують тиск до 150 мілібар для прискорення перегонки і одержання продукту. Разом отримують 664 г (70,7% від теорії) 4,5,6-трифторпіримідину з температурою кипіння 86-87°C.

Приклади застосування

Приклад А

Plasmopara тест (виноград) / захисний

розчинник: 47 вагових частин ацетону

емульгатор: 3 вагових частини алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до бажаних концентрацій.

Для випробування на захисну ефективність обприскують молоді рослини препаратом активної речовини вказаного складу.

Після висихання осаду на обприсканих рослинах інокують (заражають) рослини водними суспензіями спор *Plasmopara viticola* і залишають на один день в інкубаційній кабіні при 20°C і 100% відносній вологості повітря. Потім рослини обприскали і поставили на один день в інкубаційну кабінку.

Через 6 днів після інокуляції (зараження) здійснюють оцінку ефективності. При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку

зараження.

При цьому тесті показано, що ступінь активності наприклад сполук таких прикладів одержання (1), (2), (3), (12), (13), (14), (15), (16), (17), (18), (20), (22), (23), (24), (26), (27) і (28) складала 91% або більше в порівненні до проведеного контролю при кількості витрат активної речовини 100г/га.

Приклад В:

Sphaerotheca тест (огірки) / захисний

розчинник: 47 вагових частин ацетону

емульгатор: 3 вагових частини алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до бажаних концентрацій.

Для випробування на захисну ефективність обприскують молоді рослини препаратом активної речовини вказаного складу. Після висихання осаду на обприсканих рослинах інокують (заражають) рослини водними суспензіями спор *Sphaerotheca fuliginea*. Рослини потім помістили в теплиці при близько 23°C і відносній вологості близько 70%.

Через 10 днів після інокуляції (зараження) здійснюють оцінку ефективності. При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження.

При цьому тесті показано, що ступінь активності наприклад сполук таких прикладів одержання (1), (2), (3), (6), (7), (9), (12), (13), (14), (15), (17), (18), (20), (21), (22), (23), (24), (26), (27) і (28) складала 91% або більше в порівненні до проведеного контролю при кількості витрат активної речовини 100г/га.

Приклад С:

Venturia-тест (яблука) / захисний

розчинник: 47 вагових частин ацетону

емульгатор: 3 вагових частини алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до бажаних концентрацій.

Для випробування на захисну ефективність обприскують молоді рослини препаратом активної речовини вказаного складу. Після висихання осаду на обприсканих рослинах інокують (заражають) рослини водними конідіесуспензіями збудників яблучної парши і залишають на один день в інкубаційній кабіні при близько 20°C і 100% відносній вологості.

Рослини потім помістили в теплицю при близько 21°C і відносній вологості близько 90%.

Через 12 днів після інокуляції (зараження) здійснюють оцінку ефективності. При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження.

При цьому тесті показано, що ступінь активності наприклад сполук таких прикладів одержання (2), (3), (6), (8), (9), (12), (14), (17), (18), (21 і (28) складала 96% або більше в порівненні до проведеного контролю при кількості витрат активної речовини 10 г/га.

Приклад D:

Erysiphe-тест (ячмінь) / захисний

розчинник: 10 вагових частин N-метилпіролідону

емульгатор: 0,6 вагових частини алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до бажаних концентрацій.

Для випробування на захисну ефективність обприскують молоді рослини препаратом активної речовини вказаного складу.

Після висушування осаду на обприсканих рослинах рослини запилюють спорами *Erysiphe graminis* f. sp. hordei.

Рослини потім помістили в теплицю при близько 20°C і відносній вологості близько 80% з метою сприяння розвитку мучнистої роси.

Через 7 днів після інокуляції (зараження) здійснюють оцінку ефективності. При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження.

При цьому тесті показано, що ступінь активності наприклад сполук таких прикладів одержання (2), (3) і (8) складала 100% або більше в порівненні до проведеного контролю при кількості витрат активної речовини 250г/га.

Приклад E:

Erysiphe-тест (ячмінь) / лікувальний

розчинник: 10 вагових частин N-метилпіролідону

емульгатор: 0,6 вагових частини алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до бажаних концентрацій.

Для випробування на лікувальну ефективність запилюють молоді рослини спорами *Erysiphe graminis* f. sp. hordei. Через 48 годин після інокуляції (зараження) обприскують рослини препаратом активної речовини вказаного складу.

Рослини потім помістили в теплицю при близько 20°C і відносній вологості близько 80% з метою сприяння розвитку мучнистої роси.

Через 7 днів після інокуляції (зараження) здійснюють оцінку ефективності. При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження.

При цьому тесті показано, що ступінь активності наведених в прикладах •(2), (3), (6), (9) і (10) речовин

згідно винаходу становила 90% або більше при кількості витрат активної речовини 250г/га.

Приклад F:

Rydicularia тест (рис) / захисний

розчинник: 12,5 вагових частин ацетону

емульгатор: 0,3 вагових частини алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до бажаних концентрацій.

Для випробування на захисну ефективність сприскують молоді рослини препаратом активної речовини вказаного складу до появи крапель і через один день після висихання осаду на обприсканих рослинах інокують (заражають) рослини водними суспензіями спор *Rydicularia oryzae*. Потім стояли рослини в теплиці при 100% вологості повітря і близько 25°C.

Через 4 дні після інокуляції (зараження) здійснюють оцінку ефективності.

При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження.

При цьому тесті показано, що ступінь активності наприклад сполук таких прикладів одержання (1), (2), (3), (4), (8), (9), (10), (20), (21), (22) і (24) складала 80% або більше в порівненні до проведеного контролю при кількості витрат активної речовини 759'0г/га.

Приклад G:

Ruscinia-тест (пшениця) / захисний

розчинник: 25 вагових частин N,N- диметилацетаміду

емульгатор: 0,6 вагових частини алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до бажаних концентрацій.

Для випробування на захисну ефективність обприскують молоді рослини препаратом активної речовини вказаного складу. Після висихання осаду на обприсканих рослинах інокують (заражають) рослини кондієсуспензіями *Ruscinia recondita*. Рослини знаходились 48 годин в інкубаційній кабіні при 20°C і 100% відносній вологості повітря.

Рослини потім помістили в теплицю при близько 20°C і відносній вологості повітря близько 80% з метою сприяння розвитку.

Через 10 днів після інокуляції (зараження) здійснюють оцінку ефективності. При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження.

При цьому тесті показано, що ступінь активності наведених в прикладах (1), (2), (5), (12), (13), (14), (15), (16), (24) і (26) речовин згідно винаходу становила 90% або більше при кількості витрат активної речовини 250 г/га.

Приклад H:

Fusarium nivale (var. *nivale*)-Тест (пшениця) / захисний

розчинник: 25 вагових частин N,N- диметилацетаміду

емульгатор: 0,6 вагових частини алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до бажаних концентрацій.

Для випробування на захисну ефективність обприскують молоді рослини препаратом активної речовини вказаного складу. Після висихання осаду на обприсканих рослинах інокують (заражають) рослини кондієсуспензіями *Fusarium nivale* (var. *nivale*).

Рослини потім помістили в теплицю під світлопроникаючий інкубаційний ковпак при температурі близько 15°C і відносній вологості повітря близько 100%.

Через 4 дні після інокуляції (зараження) здійснюють оцінку ефективності. При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження.

При цьому тесті показано, що ступінь активності наведених в прикладах (1), (2), (13), (14), (15), (16), (17), (20), (21), (22), (24) і (26) речовин згідно винаходу становила 90% або більше при кількості витрат активної речовини 250г/га.

Приклад I:

Rugenophora teres (пшениця) / захисний

розчинник: 25 вагових частин N,N- диметилацетаміду

емульгатор: 0,6 вагових частини алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до бажаних концентрацій.

Для випробування на захисну ефективність обприскують молоді рослини препаратом активної речовини вказаного складу. Після висихання осаду на обприсканих рослинах інокують (заражають) рослини кондієсуспензіями *Rugenophora teres*. Рослини знаходились 48 годин в інкубаційній кабіні при 20°C і 100% відносній вологості повітря.

Рослини потім помістили в теплицю при близько 20°C і відносній вологості близько 80%.

Через 7 днів після інокуляції (зараження) здійснюють оцінку ефективності. При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження.

При цьому тесті показано, що ступінь активності наведених в прикладах (17) і (28) речовин згідно винаходу становила 90% або більше при кількості витрат активної речовини г/га.

Приклад K:

Phytophthora-тест (помідори) / захисний

розчинник: 47 вагових частин ацетону

емульгатор: 3 вагових частини алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільного препарату активної речовини змішують 1 вагову частину активної речовини з вказаною кількістю розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою до бажаних концентрацій.

Для випробування на захисну ефективність обприскують молоді рослини препаратом активної речовини вказаного складу. Після висихання осаду на обприсканих рослинах інокують рослини водними суспензіями спор *Phytophthora infestans*. Рослини потім знаходяться в інкубаційній кабіні при близько 20°C і 100% відносній вологості повітря.

Через 3 дні після інокуляції (зараження) здійснюють оцінку ефективності. При цьому 0% означає ефективність, яка відповідає контролю, а ефективність в 100% означає, що не спостерігалось жодного випадку зараження.

При цьому тесті показано, що ступінь активності наведених в прикладах (8), (9) і (10) речовин згідно винаходу становила 96% або більше при кількості витрат активної речовини г/га.