



РОССИЙСКОЕ АГЕНТСТВО
ПО ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(19) **RU** ⁽¹¹⁾ **2 194 040** ⁽¹³⁾ **C2**
(51) МПК⁷ **C 07 D 239/34, 239/38, 239/60,
405/12, 409/12, A 01 N 43/54/(C
07 D 405/12, 239:00, 307:02), (C
07 D 409/12, 239:00, 333:02), (C
07 D 409/12, 239:00, 335:02)**

(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ**

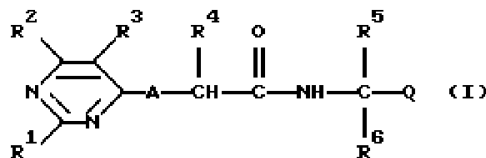
(21), (22) Заявка: 99111264/04, 30.10.1997
(24) Дата начала действия патента: 30.10.1997
(30) Приоритет: 31.10.1996 JP 8/305693
(46) Дата публикации: 10.12.2002
(56) Ссылки: EP 212969 A1, 31.05.1998. WO 94/25442 A1, 10.11.1994. RU 2041626 C1, 20.08.1994. DE 4335950 A1, 27.04.1995.
(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу: 31.05.1999
(86) Заявка РСТ: JP 97/03945 (30.10.1997)
(87) Публикация РСТ: WO 98/18766 (07.05.1998)
(98) Адрес для переписки: 129010, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр.3, ООО "Юридическая фирма Городисский и Партнеры", Н.Г. Лебедевой

(71) Заявитель: КУМИЙ КЕМИКАЛ ИНДАСТРИ КО., ЛТД. (JP), ИХАРА КЕМИКАЛ ИНДАСТРИ КО., ЛТД. (JP)
(72) Изобретатель: МАСУДА Кацуми (JP), УРУСИБАТА Икуми (JP), АСАХАРА Цуеси (JP), ФУРУСЕ Кацуми (JP), КОДЗИМА Есиюки (JP), МУРАМАЦУ Норимити (JP)
(73) Патентообладатель: КУМИЙ КЕМИКАЛ ИНДАСТРИ КО., ЛТД. (JP), ИХАРА КЕМИКАЛ ИНДАСТРИ КО., ЛТД. (JP)
(74) Патентный поверенный: Лебедева Наталья Георгиевна

(54) **ПРОИЗВОДНЫЕ ПИРИМИДИНИЛОКСИАЛКАНАМИДОВ И ФУНГИЦИДЫ ДЛЯ СЕЛЬСКОГО ХОЗЯЙСТВА ИЛИ САДОВОДСТВА**

(57)
Изобретение относится к новым производным пиримидинилоксиалканамидов общей формулы I и фунгицидам для сельского хозяйства или садоводства на их основе. В соединениях общей формулы I A означает кислород или серу, Q представляет цианогруппу или группу COR⁷, где R⁷ означает C₁-C₆-алкильную группу, C₃-C₆-циклоалкильную группу, которая может быть замещена атомом галогена или C₁-C₆-алкильной группой, C₁-C₆-галогеналкильную группу, C₁-C₆-алкоксигруппу, C₂-C₆-алкенилоксигруппу, C₂-C₆-алкинилоксигруппу или C₃-C₆-циклоалкилоксигруппу; R⁴ представляет атом водорода, C₁-C₆-алкильную группу, C₃-C₆-циклоалкильную группу или C₁-C₆-галогеналкильную группу; R¹, R², R³, R⁵, R⁶ означают водород, C₁-C₆-алкильную группу и другие группы,

указанные в формуле изобретения, или R² и R³ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют ненасыщенное 5-6-членное кольцо, или R⁵ и R⁶ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют 5-7-членную циклоалкильную группу, которая может быть замещена C₁-C₆-алкильной группой, или образуют 5-6-членную гетероциклическую группу, содержащую атом кислорода или атом серы в качестве гетероатома, и которая может быть замещена C₁-C₆-алкильной группой. Изобретение также относится к фунгициду для сельского хозяйства или садоводства, включающему вышеуказанные соединения в качестве активного ингредиента. 4 с.п. ф-лы, 26 табл.





RUSSIAN AGENCY
FOR PATENTS AND TRADEMARKS

(19) **RU** ⁽¹¹⁾ **2 194 040** ⁽¹³⁾ **C2**

(51) Int. Cl.⁷ **C 07 D 239/34, 239/38,
239/60, 405/12, 409/12, A 01 N
43/54/(C 07 D 405/12, 239:00,
307:02), (C 07 D 409/12, 239:00,
333:02), (C 07 D 409/12, 239:00,
335:02)**

(12) **ABSTRACT OF INVENTION**

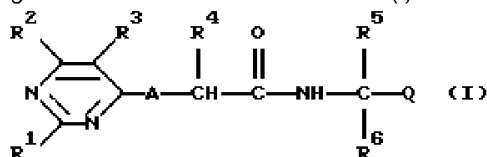
(21), (22) Application: 99111264/04, 30.10.1997
(24) Effective date for property rights: 30.10.1997
(30) Priority: 31.10.1996 JP 8/305693
(46) Date of publication: 10.12.2002
(85) Commencement of national phase: 31.05.1999
(86) PCT application:
JP 97/03945 (30.10.1997)
(87) PCT publication:
WO 98/18766 (07.05.1998)
(98) Mail address:
129010, Moskva, ul. B. Spasskaja, 25, str.3,
OOO "Juridicheskaja firma Gorodisskij i
Partnery", N.G. Lebedevoj

(71) Applicant:
KUMIAJ KEMIKAL INDASTRI KO., LTD. (JP),
IKHARA KEMIKAL INDASTRI KO., LTD. (JP)
(72) Inventor: MASUDA Katsumi (JP),
URUSIBATA Ikumi (JP), ASAKHARA Tsuesi
(JP), FURUSE Katsumi (JP), KODZIMA Esijuki
(JP), MURAMATSU Norimiti (JP)
(73) Proprietor:
KUMIAJ KEMIKAL INDASTRI KO., LTD. (JP),
IKHARA KEMIKAL INDASTRI KO., LTD. (JP)
(74) Representative:
Lebedeva Natal'ja Georgievna

(54) DERIVATIVES OF PYRIMIDINYLHYDROXYALKANEAMIDES AND FUNGICIDES FOR AGRICULTURE OR GARDENING

(57) Abstract:

FIELD: organic chemistry, fungicides.
SUBSTANCE: invention relates to novel
derivatives of
pyrimidinylhydroxyalkaneamides of the
general formula (I)



and fungicides used in agriculture or
gardening based on thereof. In compounds of
the general formula (I) A means oxygen or
sulfur atom; Q means cyano-group or group COR⁷
where R⁷ means C₁-C₆-alkyl group,
C₃-C₆-cycloalkyl-group that can be
substituted with halogen atom or
C₁-C₆-alkyl-group, C₁-C₆-halogenalkyl-group,
C₁-C₆-alkoxy-group,
C₂-C₆-alkenyl-hydroxy-group,

C₂-C₆-alkynylhydroxy-group or
C₃-C₆-cycloalkylhydroxy-group; R⁴ means
hydrogen atom, C₁-C₆-alkyl group,
C₃-C₆-cycloalkyl group or C₁-C₆-halogenalkyl
group; R¹, R², R³, R⁵, R⁶ mean hydrogen atom,
C₁-C₆-alkyl group and other groups
indicated in the invention claim; or R² and
R³ in common with carbon atom to which they
are bound form unsaturated 5-6-membered
ring; or R⁵ and R⁶ in common with carbon atom
to which they are bound form 5-7-membered
cycloalkyl group that can be substituted with
C₁-C₆-alkyl group, or they form
5-6-membered hetero-cyclyl group comprising
oxygen atom or sulfur atom as heteroatom
being this group can be substituted with
C₁-C₆-alkyl group. Invention relates also
to fungicide used in agriculture and
gardening comprising said compounds as
active component. EFFECT: valuable
properties of compounds. 4 cl, 26 tbl

Область техники

Настоящее изобретение относится к новым производным пиримидинилоксиалканамидов и к содержащим их в качестве активных ингредиентов фунгицидам, применяемым в сельском хозяйстве или садоводстве.

Предшествующий уровень техники

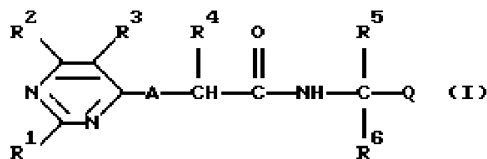
В заявке на патент Японии, первая публикация N Sho 63-132867 указывается, что фунгицидной активностью обладают производные арилоксикарбоновой кислоты. В предшествующей заявке раскрыты соединения, имеющие 2-пиримидинильную группу без заместителей в арильной группе; однако они не проявляют достаточную фунгицидную активность. Кроме того, в ней не раскрыты соединения, имеющие 4-пиримидинильную группу с заместителями.

Недавно было установлено, что общепринятые фунгициды не проявляют достаточную активность вследствие появления после повторного применения фунгицидов устойчивых грибов. Кроме этого, а также вследствие возникающих при этом проблем, связанных с охраной окружающей среды, было бы желательно обеспечить новые фунгициды, с помощью которых можно эффективно бороться с вредными грибами даже при низких концентрациях. Настоящее изобретение предусматривает новые производные пиримидинилоксиалканамидов, проявляющие превосходную фунгицидную активность.

Поэтому настоящие изобретатели синтезировали различные новые производные пиримидинилоксиалканамидов и провели интенсивные исследования, направленные на изучение их воздействия на биологическую активность грибов. В результате изобретатели обнаружили, что новые соединения в соответствии с настоящим изобретением обладают широким спектром фунгицидной активности и проявляют превосходную фунгицидную активность в отношении пирикулярриоза риса и подобных заболеваний и в то же время не препятствуют необходимому росту растений.

Описание изобретения

Настоящее изобретение предусматривает производные пиримидинилоксиалканамидов, представленные формулой (I)



где R¹ представляет собой атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу, C₁-C₄ галогеналкильную группу, C₁-C₆ алкоксигруппу, C₂-C₆ алкенилоксигруппу, C₂-C₆ алкинилоксигруппу, C₃-C₆ циклоалкилоксигруппу, C₁-C₆ алкилтиогруппу, C₁-C₆ алкилсульфинильную группу, C₁-C₆ алкилсульфонильную группу, C₂-C₆ алкенилтиогруппу, C₂-C₆ алкинилтиогруппу, C₃-C₆ циклоалкилтиогруппу,

C₁-C₆ алкиламиногруппу, ди(C₁-C₆ алкил)аминогруппу, атом галогена, фенильную группу (которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой или атомом галогена) или феноксигруппу (которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой или атомом галогена),

R² представляет собой атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу, C₂-C₆ алкенильную группу, C₂-C₆ алкинильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу, C₁-C₄ галогеналкильную группу, C₂-C₆ галогеналкенильную группу, C₁-C₆ алкоксигруппу, C₂-C₆ алкенилоксигруппу, C₂-C₆ алкинилоксигруппу, C₃-C₆ циклоалкилоксигруппу, C₁-C₄ галогеналкоксигруппу, C₁-C₆ алкилтиогруппу, C₂-C₆ алкенилтиогруппу, C₂-C₆ алкинилтиогруппу, C₁-C₆ алкиламиногруппу,

ди(C₁-C₆ алкил)аминогруппу, атом галогена или фенильную группу (которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой или атомом галогена),

R³ представляет собой атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу, C₁-C₄ галогеналкильную группу, C₁-C₆ алкоксигруппу, (C₁-C₆ алкил)карбонильную группу, (C₁-C₆ алкокси)карбонильную группу, атом галогена, нитрогруппу или цианогруппу или

R² и R³ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют насыщенное 6-членное кольцо или ненасыщенное 5-членное или 6-членное кольцо,

R⁴ представляет собой атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу или C₁-C₄ галогеналкильную группу,

R⁵ и R⁶ независимо представляют собой атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу, C₂-C₆ алкенильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу (которая может быть замещена атомом галогена или C₁-C₆ алкильной группой), C₃-C₆ циклоалкил C₁-C₆ алкильную группу, C₁-C₆ алкокси C₁-C₆ алкильную группу или C₁-C₄ галогеналкильную группу, либо

R⁵ и R⁶ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют 5-членную ~7-членную циклоалкильную группу (которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой) или гетероциклическую группу (которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой),

Q представляет собой цианогруппу или группу формулы -COR⁷ [где R⁷ представляет

собой C₁-C₆ алкильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу (которая может быть замещена атомом галогена или C₁-C₆ алкильной группой), C₁-C₄ галогеналкильную группу, C₁-C₆ алкоксигруппу, C₂-C₆ алкенилоксигруппу, C₂-C₆ алкинилоксигруппу или C₃-C₆ циклоалкилоксигруппу] и

А представляет собой атом кислорода или атом серы, а также фунгициды для сельского хозяйства или садоводства, включающие в качестве основного ингредиента производное пиридинилоксиалканамида.

Термины, применяемые в настоящем изобретении, определены следующим образом. Так, например, в настоящем изобретении в случае выражения "C₁-C₆" группа, показанная после "C₁-C₆", имеет от 1 до 6 атомов углерода.

Применяемый в этом изобретении термин "C₁-C₆ алкильная группа" означает алкильную группу с прямой или разветвленной цепью, включающей, например, метильную группу, этильную группу, н-пропильную группу, изопропильную группу, н-бутильную группу, изобутильную группу, втор-бутильную группу, трет-бутильную группу, н-пентильную группу, изопентильную группу, неопентильную группу, н-гексильную группу, изогексильную группу, 3,3-диметилбутильную группу или подобные группы.

В качестве термина "C₃-C₆ циклоалкильная группа" здесь может быть упомянута, например, циклопропильная группа, циклопентильная группа, циклогексильная группа или подобная.

В качестве термина "C₃-C₆ циклоалкил C₁-C₆ алкильная группа" может быть упомянута, например, циклопропилметильная группа, циклопентилметильная группа, циклогексилметильная группа или подобная.

Термин "C₁-C₄ галогеналкильная группа" применяют в этом изобретении для обозначения галогензамещенной алкильной группы с прямой или разветвленной цепью, включающей, например, фторметильную группу, хлорметильную группу, бромметильную группу, дифторметильную группу, дихлорметильную группу, дибромметильную группу, трифторметильную группу, хлордифторметильную группу, пентафторэтильную группу или подобную.

Термин "C₂-C₆ алкенильная группа" применяют в этом изобретении для обозначения алкенильной группы с прямой или разветвленной цепью, включающей, например, винильную группу, 1-пропенильную группу, аллильную группу, изопропенильную группу, 1-бутенильную группу, 2-бутенильную группу или подобную группу.

Термин "C₂-C₆ алкинильная группа" применяют в этом изобретении для обозначения алкинильной группы с прямой или разветвленной цепью, включающей, например, этинильную группу, 1-пропинильную группу, 2-пропинильную группу, 1-бутинильную группу, 2-бутинильную группу, 3-бутинильную группу, 4-метил-1-пентинильную группу, 3-метил-1-пентинильную группу или подобную группу.

Термин "атом галогена" применяют здесь

для обозначения атома фтора, атома хлора, атома брома или атома йода.

Термин "C₁-C₆ алкоксигруппа" применяют в этом изобретении для обозначения алкоксигруппы с прямой или разветвленной цепью, включающей, например, метоксигруппу, этоксигруппу, н-пропоксигруппу, изопропоксигруппу, н-бутоксигруппу, изобутоксигруппу, втор-бутоксигруппу, трет-бутоксигруппу, н-пентилоксигруппу, изопентилоксигруппу, н-гексиллоксигруппу или подобную.

Термин "C₂-C₆ алкенилоксигруппа" применяют в этом изобретении для обозначения алкенилоксигруппы с прямой или разветвленной цепью, включающей, например, аллилоксигруппу, изопропенилоксигруппу, 2-бутенилоксигруппу или подобную.

Термин "C₂-C₆ алкинилоксигруппа" применяют в этом изобретении для обозначения алкинилоксигруппы с прямой или разветвленной цепью, включающей, например, 2-пропинилоксигруппу, 2-бутинилоксигруппу, 3-бутинилоксигруппу или подобную.

В качестве "C₃-C₆ циклоалкилоксигруппы" в этом изобретении могут быть упомянуты, например, циклопропилоксигруппа, циклопентилоксигруппа, циклогексиллоксигруппа или подобная.

Термин "C₁-C₄ галогеноксигруппа" применяют в этом изобретении для обозначения галогензамещенной алкоксигруппы с прямой или разветвленной цепью, включающей, например, фторметоксигруппу, дифторметоксигруппу, трифторметоксигруппу, пентафторэтоксигруппу или подобную.

Термин "C₁-C₆ алкилтиогруппа" применяют в этом изобретении для обозначения алкилтиогруппы с прямой или разветвленной цепью, включающей, например, метилтиогруппу, этилтиогруппу, н-пропилтиогруппу, изопропилтиогруппу, н-бутилтиогруппу, изобутилтиогруппу, втор-бутилтиогруппу, трет-бутилтиогруппу, н-гексилтиогруппу или подобную.

Термин "C₁-C₆ алкилсульфинильная группа" применяют в этом изобретении для обозначения алкилсульфинильной группы с прямой или разветвленной цепью, включающей, например, метилсульфинильную группу, этилсульфинильную группу, н-пропилсульфинильную группу, изопропилсульфинильную группу, н-бутилсульфинильную группу, изобутилсульфинильную группу, втор-бутилсульфинильную группу, трет-бутилсульфинильную группу, н-гексилсульфинильную группу или подобную.

Термин "C₁-C₆ алкилсульфонильная группа" применяют в этом изобретении для обозначения алкилсульфонильной группы с прямой или разветвленной цепью, включающей, например, метилсульфонильную группу, этилсульфонильную группу, н-пропилсульфонильную группу, изопропилсульфонильную группу, н-бутилсульфонильную группу, изобутилсульфонильную группу, втор-бутилсульфонильную группу,

трет-бутилсульфонильную группу, н-гексилсульфонильную группу или подобную. Термин "C₁-C₆ алкиламиногруппа" применяют в этом изобретении для обозначения алкиламиногруппы с прямой или разветвленной цепью, включающей, например, метиламиногруппу, этиламиногруппу, н-пропиламиногруппу, изопропиламиногруппу, н-бутиламиногруппу, изобутиламиногруппу, втор-бутиламиногруппу, трет-бутиламиногруппу, н-гексиламиногруппу или подобную.

В виде термина "ди(C₁-C₆ алкил)аминогруппа" в этом изобретении может быть упомянута, например, диметиламиногруппа, диэтиламиногруппа, дипропиламиногруппа, дибутиламиногруппа или подобная.

Термин "(C₁-C₆ алкил)карбонильная группа" применяют в этом изобретении для обозначения алкилкарбонильной группы с прямой или разветвленной цепью, включающей, например, ацетильную группу, пропионильную группу, бутирильную группу, изобутирильную группу или подобную.

Термин "(C₁-C₆ алкокси)карбонильная группа" применяют в этом изобретении для обозначения алкоксикарбонильной группы с прямой или разветвленной цепью, включающей, например, метоксикарбонильную группу, этоксикарбонильную группу, н-пропоксикарбонильную группу, изопропоксикарбонильную группу, н-бутоксикарбонильную группу, изобутоксикарбонильную группу, втор-бутоксикарбонильную группу, трет-бутоксикарбонильную группу, н-пентилоксикарбонильную группу, н-гексилоксикарбонильную группу или подобную.

Термин "гетероциклическая группа" применяют в этом изобретении для обозначения насыщенной циклической группы, включающей в качестве составляющего атома, по меньшей мере, один атом кислорода или атом серы, которая включает, например, 3-оксоланильную группу, 4-оксоланильную группу, 3-тиоланильную группу, 4-тиоланильную группу или подобную.

Соединения, представленные формулой (I), в соответствии с настоящим изобретением могут существовать благодаря присутствию в молекуле одного или нескольких асимметрических атомов углерода, в виде оптических изомеров. Настоящее изобретение относится к диастереомерам, энантиомерам и их смесям.

Предпочтительными соединениями, представленными формулой (I) в соответствии с настоящим изобретением, являются такие, в которых:

R¹ представляет собой атом водорода, метильную группу, циклопропильную группу, метилтиогруппу, этилтиогруппу, аллил-тиогруппу, пропаргилтиогруппу, метоксигруппу, этоксигруппу, феноксигруппу или фенильную группу,

R² представляет собой метильную группу, этильную группу, изопропильную группу, трифторметильную группу, хлордифторметильную группу, дифторметильную группу, дихлорметильную группу, дибромметильную группу,

метоксигруппу, метилтиогруппу или атом хлора,

R³ представляет собой атом водорода, метильную группу, этильную группу, атом хлора или атом брома,

R⁴ представляет собой атом водорода, метильную группу или этильную группу,

R⁵ представляет собой атом водорода, метильную группу, этильную группу или н-пропильную группу,

R⁶ представляет собой метильную группу, этильную группу, н-пропильную группу, изопропильную группу, н-бутильную группу, изобутильную группу, втор-бутильную группу, трет-бутильную группу, циклопропильную группу, циклопентильную группу или дихлорметильную группу, и

Q представляет собой цианогруппу, ацетильную группу, пропионильную группу, метоксикарбонильную группу или этокси-карбонильную группу.

Далее в таблицах 1-15 перечислены характерные соединения, представленные формулой (I), в соответствии с настоящим изобретением. Однако следует понимать, что настоящее изобретение не ограничено такими соединениями. Номера соединений, указанные в таблицах, соответствуют номерам, приведенным в последующем описании.

В таблицах "Me" означает метальную группу, "Et" означает этильную группу, "n-Pr" означает н-пропильную группу, "i-Pr" означает изопропильную группу, "n-Bu" означает н-бутильную группу, "i-Bu" означает изобутильную группу, "s-Bu" означает втор-бутильную группу, "t-Bu" означает трет-бутильную группу и "Ph" означает фенильную группу. Следовательно, "Ph(4-C1)" означает 4-хлорфенильную группу,

"Изомер А" представляет собой диастереомер А-конфигурации, "Изомер В" представляет собой диастереомер В-конфигурации и "Изомер М" представляет собой смесь диастереомера А-конфигурации и диастереомера В-конфигурации. "Изомер RA" представляет собой диастереомер А-конфигурации, где кислотная группа является оптически активной группой (R-конфигурации), "Изомер RB" представляет собой диастереомер В-конфигурации, где кислотная группа является оптически активной группой (R-конфигурации) и "Изомер RM" представляет собой смесь диастереомеров, где кислотная группа является оптически активной группой (R-конфигурации). "Изомер SA" представляет собой диастереомер А-конфигурации, где кислотная группа является оптически активной группой (S-конфигурации). "Изомер SB" представляет собой диастереомер В-конфигурации, где кислотная группа является оптически активной группой (S-конфигурации) и "Изомер SM" представляет собой смесь диастереомеров, где кислотная группа является оптически активной группой (S-конфигурации). "Диастереомер А-конфигурации" означает низкополярный диастереомер, выделенный колоночной хроматографией на силикагеле, высокоэффективной жидкостной хроматографией или подобными методами, тогда как "диастереомер В-конфигурации" означает высокополярный диастереомер, выделенный вышеупомянутыми способами.

Соединения, представленные формулой (I), могут быть синтезированы, например, в соответствии с нижеприведенными способами получения.

Способ получения 1 (см схему 1 в конце описания).

Соединения формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением могут быть получены посредством реакции производных пиримидинилоксиалкановой кислоты, представленных формулой (II), с аминами, представленными формулой (III), с использованием конденсирующего агента и, если необходимо, в присутствии катализатора и/или основания. Настоящую реакцию обычно осуществляют в растворителе: этим растворителем может быть любой растворитель, который не мешает протеканию реакции, например углеводороды, такие как пентан, гексан, гептан, циклогексан, петролейный эфир, лигроин, бензол, толуол, ксилол и подобные растворители, галогенированные углеводороды, например дихлорметан, дихлорэтан, хлороформ, четыреххлористый углерод, хлорбензол, дихлорбензол и подобные растворители, простые эфиры, например диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, диметиловый эфир этиленгликоля, тетрагидрофуран, диоксан и подобные растворители, кетоны, например ацетон, метилэтилкетон, метилизопропилкетон, метилизобутилкетон и подобные растворители, сложные эфиры, например метилацетат, этилацетат и подобные, нитрилы, например ацетонитрил, пропионитрил и подобные растворители, апротонные полярные растворители, например диметилсульфоксид, N, N-диметилформамид, сульфолан и подобные, и смеси растворителей, выбранных из вышеуказанных растворителей.

В качестве конденсирующего агента могут быть названы гидрохлорид 1-этил-3-(3-диметиламинопропил)карбодиимида, N, N'-дициклогексилкарбодиимид, карбонилдиимидазол, 2-хлор-1,3-диметилимидазолийхлорид или подобные средства.

В качестве катализатора могут быть названы, например, 4-диметиламинопиридин, 1-гидроксibenзотриазол, диметилформамид или подобные соединения.

Основанием может быть любой тип основания, обычно применяемого в этом типе реакции. Так, например, могут быть названы гидроксиды щелочных металлов, например гидроксид натрия, гидроксид калия и подобные, гидроксиды щелочноземельных металлов, например гидроксид кальция и подобные, карбонаты щелочных металлов, например карбонат натрия, карбонат калия и подобные соединения, органические основания, например триэтиламин, триметиламин, N,N-диметиланилин, пиридин, N-метилпиридин, 1,5-диазабицикло[4.3.0]нон-5-ен (DBN), 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-ен (DBU) и подобные соединения, и предпочтительно третичные амины, например триэтиламин, пиридин, N-метилпиперидин и подобные соединения.

Настоящую реакцию осуществляют при температуре в диапазоне от -50°C до 150°C и предпочтительно при температуре в диапазоне от 0°C до 60°C. Время реакции предпочтительно находится в диапазоне от 1

до 30 часов.

Далее будет объяснен способ синтеза каждого исходного вещества.

Соединения, представленные формулой (II), могут быть синтезированы, например, в соответствии с нижепоказанными способами получения (см. схему 2 в конце описания).

Производные пиримидинилоксиалкановой кислоты, представленные формулой (II), могут быть получены, например, путем взаимодействия производных пиримидина, представленных формулой (IV), с производными сложных эфиров алкановых кислот, представленных формулой (VI), в присутствии основания с получением производных сложных эфиров пиримидинилоксиалкановых кислот, представленных формулой (V), и последующего гидролиза производных сложных эфиров пиримидинилоксиалкановых кислот.

В соответствии с вышеописанными реакционными схемами реакцию производных пиримидина, представленных формулой (IV), с производными сложного эфира, представленными формулой (VI), осуществляют обычно в растворителе: этим растворителем может быть любой растворитель, который не мешает протеканию реакции, например углеводороды, такие как пентан, гексан, гептан, циклогексан, петролейный эфир, лигроин, бензол, толуол, ксилол и подобные растворители, галогенированные углеводороды, например дихлорметан, дихлорэтан, хлороформ, четыреххлористый углерод, хлорбензол, дихлорбензол и подобные растворители, простые эфиры, например диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, диметиловый эфир этиленгликоля, тетрагидрофуран, диоксан и подобные растворители, кетоны, например ацетон, метилэтилкетон, метилизопропилкетон, метилизобутилкетон и подобные, ацетаты, например метилацетат, этилацетат и подобные, нитрилы, например ацетонитрил, пропионитрил и подобные растворители, апротонные полярные растворители, например диметилсульфоксид, N,N-диметилформамид, сульфолан и подобные, и смеси растворителей, выбранных из вышеуказанных растворителей.

Основанием может быть любой тип основания, обычно применяемого в этом типе реакции. Так, например, могут быть названы неорганические основания, например гидроксид натрия, гидроксид калия, карбонат натрия, карбонат калия, бикарбонат натрия, гидрид натрия, гидрид калия и подобные, или органические основания, например триэтиламин, триметиламин, N,N-диметиланилин, пиридин и подобные.

Настоящую реакцию осуществляют при температуре в диапазоне от -50°C до 150°C и предпочтительно при температуре в диапазоне от 0°C до 60°C. Время реакции предпочтительно находится в диапазоне от 1 до 30 часов.

Реакцию получения производных пиримидинилоксиалкановой кислоты, представленных формулой (II), посредством гидролиза производных сложных эфиров пиримидинилоксиалкановых кислот, представленных формулой (V), осуществляют обычно в растворителе: этим растворителем может быть любой растворитель, который не

мешает протеканию реакции, например вода, спирты, такие как метанол, этанол, 2-пропанол и подобные, простые эфиры, например диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, диметиловый эфир этиленгликоля, тетрагидрофуран, диоксан и подобные растворители, кетоны, например ацетон, метилэтилкетон, метилизопропилкетон, метилизобутилкетон и смеси растворителей, содержащие растворители, выбранные из вышеуказанных.

Основанием может быть любой тип основания, обычно применяемого в этом типе реакции. Так, например, могут быть названы неорганические основания, например гидроксид натрия, гидроксид калия и подобные основания.

Настоящую реакцию осуществляют при температуре в диапазоне от -50°C до 150°C и предпочтительно при температуре в диапазоне от 0°C до 60°C. Время реакции предпочтительно находится в диапазоне от 1 до 30 часов.

Соединения, представленные формулой (IV), могут быть синтезированы, например, в соответствии с известными методами, такими как хлорирование гидроксипиримидинов с применением оксихлорида фосфора (см. Tetrahedron, Vol. 35, p. 2087, 1979; или Journal of Heterocyclic Chemistry, Vol. 20, p. 219, 1983).

Соединения, представленные формулой (III), могут быть получены, например, с применением кетонов, цианида натрия и хлорида аммония в соответствии с методом Strecker (Стрекера), который раскрыт в: Organic Syntheses, Vol. 3, p. 88, 1955; Journal of Medicinal Chemistry, Vol. 9, p. 911, 1966; или в: Tetrahedron Letters, Vol. 17, p. 1455, 1977.

Способ получения 2 (см. схему 3 в конце описания).

Соединения формулы (I-1) в соответствии с настоящим изобретением могут быть получены посредством реакции производных пиримидина, представленных формулой (VII), с производными алканамида, представленными формулой (VIII), в присутствии основания. Настоящую реакцию можно осуществить в растворителе: этим растворителем может быть тот же самый растворитель, который описан в способе получения 1, и который не мешает протеканию реакции.

Основанием может быть любой тип основания, обычно применяемого в этом типе реакции. Так, например, могут быть названы неорганические основания, например гидроксид натрия, гидроксид калия, карбонат натрия, карбонат калия, бикарбонат натрия, гидрид натрия, гидрид калия и подобные, или органические основания, например триэтиламин, триметиламин, N,N-диметиламин, пиридин и подобные.

Настоящую реакцию осуществляют при температуре в диапазоне от -50°C до 150°C и предпочтительно при температуре в диапазоне от 0°C до 60°C. Время реакции предпочтительно находится в диапазоне от 1 до 30 часов.

Участвующие в настоящей реакции соединения, представленные формулой (VII), могут быть получены, например, в соответствии с реакцией производных пиримидина, представленных формулой (IV),

с тиомочевинной.

Кроме того, соединения, представленные формулой (VIII), могут быть получены, например, в соответствии с реакцией галогенированных алканогалогенидов с производными аминов, представленными формулой (III).

Способ получения 3 (см. схему 4 в конце описания).

Соединения формулы (I-2) в соответствии с настоящим изобретением могут быть получены посредством реакции производных пиримидина, представленных формулой (IV), с производными алканамида, представленными формулой (IX), в присутствии основания. Настоящую реакцию можно осуществить в растворителе: этим растворителем может быть тот же самый растворитель, который описан в способе получения 1 и который не мешает протеканию реакции.

В качестве основания можно использовать то же самое основание, которое было описано в способе получения 2.

Настоящую реакцию осуществляют при температуре в диапазоне от -50°C до 150°C и предпочтительно при температуре в диапазоне от 0°C до 60°C. Время реакции предпочтительно находится в диапазоне от 1 до 30 часов.

Участвующие в настоящей реакции соединения, представленные формулой (IX), могут быть получены, например, деацилированием производных ацетоксиалканамидов, полученных посредством реакции галогенированных производных алканамидов, представленных формулой (VIII), с ацетатом натрия.

Лучшие варианты осуществления изобретения

В последующем описании изобретения приводятся примеры получения соединений в соответствии с настоящим изобретением.

Пример получения 1

Синтез

2-(5-хлор-6-этилпиримидин-4-илокси)-N-(1-циано-1,2-диметилпропил)ацетамида (соединение A-7)

К раствору, содержащему 2-(5-хлор-6-этилпиримидин-4-илокси)уксусную кислоту (1,0 г), растворенную в метиленхлориде (50 мл), при комнатной температуре добавляют гидроксид 1-этил-3-(3-диметиламинопропил)карбодиимида и смесь перемешивают в течение 10 минут. Затем к смеси добавляют 2-амино-2,3-диметилбутиронитрил (0,5 г) и реакционную смесь перемешивают в течение 3 часов при комнатной температуре. После завершения реакции к полученной смеси добавляют воду и слой метиленхлорида промывают водой и после этого сушат над безводным сульфатом магния. При пониженном давлении удаляют метиленхлорид. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, при этом получают 0,8 г целевого соединения, имеющего показатель преломления, равный 1,5166 (20°C).

Ссылочный пример 1-а

Синтез этил

2-(5-хлор-6-этилпиримидин-4-илокси)ацетата 60% гидрид натрия (0,5 г) промывают гексаном и затем суспендируют в тетрагидрофуране (50 мл). К суспензии,

находящейся в бане, охлажденной льдом, по каплям добавляют этилгликолят (1,2 г) и затем смесь перемешивают в течение часа при комнатной температуре. После этого к ней по каплям добавляют 4,5-дихлор-6-этилпиримидин (2,0 г) и реакционную смесь перемешивают при комнатной температуре в течение 3 часов. После завершения реакции к реакционной жидкости добавляют воду. Органический слой экстрагируют этилацетатом и затем сушат над безводным сульфатом магния. При пониженном давлении удаляют этилацетат. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, при этом получают 2,6 г целевого продукта в виде масла.

Ссылочный пример 1-b

Синтез

2-(5-хлор-6-этилпиримидин-4-илокси)уксусной кислоты (Промежуточное соединение 2)

В этаноле (50 мл) растворяют этил 2-(5-хлор-6-этилпиримидин-4-илокси)ацетат (2,6 г). К нему по каплям добавляют раствор, содержащий гидроксид натрия (0,7 г) и затем смесь перемешивают в течение часа при комнатной температуре. После завершения реакции к реакционной жидкости добавляют воду и затем подкисляют лимонной кислотой. Органический слой экстрагируют этилацетатом и после этого сушат над безводным сульфатом магния. При пониженном давлении удаляют этилацетат. Полученные кристаллы промывают гексаном, при этом получают 1,4 г целевого продукта, имеющего температуру плавления от 158 °C до 159 °C.

В таблице 16 показаны физические свойства пиримидинилоксиалкановых кислот, которые являются промежуточными соединениями соединений в соответствии с настоящим изобретением, которые получают способом, подобным тому, который описан в ссылочном примере 1-a и ссылочном примере 1-b.

Пример получения 2

Синтез метил

2-(1-(5-хлор-6-трифторметилпиримидин-4-илокси)этилкарбониламино)-2,3-диметилбутирата (Соединение A-93)

К раствору, содержащему 2-(5-хлор-6-трифторметилпиримидин-4-илокси) пропионовую кислоту (1,4 г), растворенную в метилхлориде (20 мл), при комнатной температуре добавляют гидрохлорид 1-этил-3-(3-диметиламинопропил)карбодиимида (1,1 г) и смесь перемешивают в течение 10 минут. После этого к смеси добавляют метил 2-амино-2,3-диметилбутират (0,8 г) и реакционную смесь перемешивают в течение 4 часов при комнатной температуре. После завершения реакции к полученной смеси добавляют воду и слой метилхлорида промывают водой, после чего сушат над безводным сульфатом магния. При пониженном давлении удаляют метилхлорид. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, при этом получают 1,3 г целевого соединения, имеющего температуру плавления от 85 °C до 86 °C.

Ссылочный пример 2-a

Синтез этил

2-(5-хлор-6-трифторметилпиримидин-4-илокси)пропионата

60% гидрид натрия (0,6 г) промывают гексаном и затем суспендируют в тетрагидрофуране (50 мл). К суспензии, находящейся в бане, охлажденной льдом, по каплям добавляют этиллактат (2,0 г) и затем смесь перемешивают в течение часа при комнатной температуре. После этого к смеси, находящейся в бане, охлажденной льдом, по каплям добавляют 4,5-дихлор-6-трифторметилпиримидин (3,1 г) и реакционную смесь перемешивают при комнатной температуре в течение 3 часов. После завершения реакции к реакционной жидкости добавляют воду. Органический слой экстрагируют этилацетатом и затем сушат над безводным сульфатом магния. При пониженном давлении удаляют этилацетат. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, при этом получают 3,5 г целевого продукта в виде масла.

Ссылочный пример 2-b

Синтез

2-(5-хлор-6-трифторметилпиримидин-4-илокси)пропионовой кислоты (Промежуточное соединение 6)

В 1,4-диоксане (20 мл) растворяют этил 2-(5-хлор-6-трифторметилпиримидин-4-илокси)пропионат (3,5 г). В баню, охлажденную льдом, добавляют раствор, содержащий гидроксид натрия (0,8 г), растворенный в воде (10 мл), и затем смесь перемешивают в течение часа при комнатной температуре. После завершения реакции к реакционной жидкости добавляют воду. Затем реакционную смесь подкисляют лимонной кислотой. Органический слой экстрагируют этилацетатом и затем сушат над безводным сульфатом магния. При пониженном давлении удаляют этилацетат. Полученные кристаллы промывают гексаном, при этом получают 2,3 г целевого продукта, имеющего температуру плавления от 112 °C до 113 °C.

Пример получения 3

Синтез

2-(5-хлор-6-трифторметилпиримидин-4-илокси)-N-(1-цианоциклопентил)пропионамида (Соединение A-80)

К раствору, содержащему 2-(5-хлор-6-трифторметилпиримидин-4-илокси)пропионовую кислоту (1,0 г), растворенную в хлороформе (30 мл), при комнатной температуре добавляют гидрохлорид 1-этил-3-(3-диметиламинопропил)карбодиимида (1,1 г) и смесь перемешивают в течение 30 минут. Затем к смеси добавляют 1-амино-циклопентанкарбонитрил (0,4 г) и реакционную смесь перемешивают в течение 10 часов при комнатной температуре. После завершения реакции к полученной смеси добавляют воду и слой хлороформа промывают водой, после чего сушат над безводным сульфатом магния. При пониженном давлении удаляют хлороформ. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, при этом получают 0,6 г целевого соединения, имеющего температуру плавления от 172 °C до 174 °C.

Пример получения 4

Синтез

2-(5-хлор-2-метил-6-трифторметилпиримидин-4-илокси)-N-(1-циано-1,2,2-триметилпропил)пропионамида (Соединения A-151 и A-152)

К раствору, содержащему

2-(5-хлор-2-метил-6-трифторметилпиримидин-4-илокси)пропионовую кислоту (1/0 г), растворенную в тетрагидрофуране (30 мл), при комнатной температуре добавляют гидрохлорид 1-этил-3-(3-диметиламинопропил)карбодиимида (0,8 г) и смесь перемешивают в течение 30 минут. После этого к смеси добавляют 2-амино-2,3,3-триметилбутиронитрил (0,5 г) и реакционную смесь перемешивают в течение 10 часов при комнатной температуре. После завершения реакции к полученной смеси добавляют воду, этилацетатом экстрагируют органический слой и затем сушат над безводным сульфатом магния. При пониженном давлении удаляют этилацетат. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, при этом получают 0,3 г диастереомера А-конфигурации, имеющего температуру плавления от 133 °С до 134 °С, и 0,2 г диастереомера В-конфигурации, имеющего температуру плавления от 137 °С до 139 °С.

Пример получения 5

Синтез

2-(5-хлор-6-изопропилпиримидин-4-илтио)-N-(1-циано-1,2-диметилпропил)пропионамида (Соединение В-17)

60% гидрид натрия (0,1 г) промывают гексаном и затем суспендируют в диметилформамиде (20 мл). К суспензии по каплям добавляют 5-хлор-6-изопропил-4-меркаптопиримидин (0,2 г) и затем смесь перемешивают в течение одного часа при комнатной температуре. После этого к ней по каплям добавляют N-(1-циано-1,2-диметилпропил)-2-бромпропионамид (0,3 г) и реакционную смесь перемешивают при комнатной температуре в течение 3 часов. После завершения реакции к реакционной жидкости добавляют воду. Органический слой экстрагируют этилацетатом и затем сушат над безводным сульфатом магния. При пониженном давлении удаляют этилацетат. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, при этом получают 0,3 г целевого продукта, имеющего температуру плавления от 73 °С до 75 °С.

Пример получения 6

Синтез

2-(2-аллилтио-6-трифторметилпиримидин-4-илокси)-N-(1-циано-1,2-диметилпропил)пропионамида (Соединение А-251)

В тетрагидрофуране (30 мл) растворяют N-(1-циано-1,2-диметилпропил)-2-гидроксипропионамид (1,0 г). К раствору добавляют 60% гидрид натрия (0,2 г) и затем смесь перемешивают в течение 30 минут при комнатной температуре. После этого к смеси добавляют 2-аллилтио-4-хлор-6-трифторметилпиримидин (0,7 г) и затем реакционную смесь перемешивают в течение 6 часов при комнатной температуре. После завершения реакции к реакционной жидкости добавляют воду. Затем этилацетатом экстрагируют органический слой и сушат над безводным сульфатом магния. При пониженном давлении удаляют этилацетат. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, при этом получают 1,1 г целевого продукта, имеющего температуру плавления от 96 °С до 98 °С.

Пример получения 7

Синтез

2-(5-хлор-2-метил-6-трифторметилпиримидин-4-илокси)-N-(1-изопропил-1-метил-2-оксопропил)пропионамида (Соединение А-334)

К раствору, содержащему

2-(5-хлор-2-метил-6-трифторметилпиримидин-4-илокси)пропионовую кислоту (0,9 г), растворенную в дихлорметане (20 мл), при комнатной температуре добавляют гидрохлорид

1-этил-3-(3-диметиламинопропил)карбодиимида (0,7 г) и смесь перемешивают в течение 10 минут. После этого к смеси добавляют 3-амино-3,4-диметил-2-пентанон (0,4 г) и реакционную смесь перемешивают в течение 3 часов при комнатной температуре. После завершения реакции к полученной смеси добавляют воду и слой дихлорметана промывают водой и затем сушат над безводным сульфатом магния. При пониженном давлении удаляют дихлорметан. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, при этом получают 0,8 г целевого продукта, имеющего температуру плавления от 124 °С до 126 °С.

Фунгициды для сельского хозяйства или садоводства в соответствии с настоящим изобретением включают в качестве активных ингредиентов производные пиримидинилоксиалканамидов, представленные формулой (I). В случае, когда соединения в соответствии с настоящим изобретением применяют в качестве фунгицидов для сельского хозяйства или садоводства, соединения, действующие в качестве активных ингредиентов в зависимости от цели, могут быть соответствующим образом сформулированы, т.е. включены в состав препаратов. Обычно активный ингредиент разбавляют в инертной жидкости или твердом носителе и в случае необходимости к нему добавляют поверхностно-активное вещество и подобные вещества. После этого смесь известным способом формулируют, например, в тонкодисперсный порошок (дуст), смачивающий порошок, концентрат эмульсии, гранулы или подобные формы.

В качестве подходящих носителей, применяемых в составе, могут быть названы твердые носители, например тальк, бентонит, глина, каолин, диатомовая земля, белая сажа, вермикулит, гашеная известь, кремниевый песок, сульфат аммония, мочевины или подобные вещества; и жидкие носители, например изопропиловый спирт, ксилол, циклогексанон, метилнафталин и подобные вещества. В качестве поверхностно-активных веществ и диспергаторов могут быть названы, например, динафталинметандисульфат, эфиры спирта и серной кислоты, алкиларилсульфонаты, лигнинсульфонаты, эфиры полиоксиэтиленгликоля, алкиларилловые эфиры полиоксиэтилена, полиоксиэтиленсорбитан-моноалкилаты и подобные вещества. В качестве вспомогательных веществ могут быть названы карбоксиметилцеллюлоза и подобные вещества. Сформулированный фунгицид для сельского хозяйства или садоводства в соответствии с настоящим изобретением может быть нанесен опрыскиванием после соответствующего разбавления или может быть нанесен непосредственно.

Фунгициды для сельского хозяйства или садоводства в соответствии с настоящим изобретением могут быть применены для опрыскивания стеблевой и листовой частей растения, внесения в почву и погружения. Содержание активного ингредиента выбирают таким, которое является необходимым. При получении тонкодисперсного порошка или гранул предпочтительным является содержание активного ингредиента от 0,1% по весу до 20% по весу. Для концентратов эмульсий или смачивающихся порошков предпочтительное содержание активного ингредиента составляет от 5% по весу до 80% по весу.

Доза внесения фунгицида для сельского хозяйства или садоводства в соответствии с настоящим изобретением может изменяться в зависимости от вида соединения, вида насекомого-вредителя или заболевания, против которого осуществляют борьбу, от причины появления насекомого-вредителя или заболевания, степени повреждения растения, условий окружающей среды, формы применяемого препарата и подобных обстоятельств. Когда фунгициды для сельского хозяйства или садоводства настоящего изобретения наносят непосредственно в форме тонкодисперсного порошка или гранул, рекомендуется, чтобы доза внесения активного ингредиента была соответственно выбрана в диапазоне от 0,1 г до 5 кг/10 ар и предпочтительно в диапазоне от 1 г до 1 кг/10 ар. Когда фунгициды настоящего изобретения находятся в форме жидкости, например в виде концентрата эмульсии или смачивающегося порошка, рекомендуется, чтобы доза внесения активного ингредиента была соответственно выбрана в диапазоне от 0,1 част. на миллион до 10000 част. на миллион (от 0,1 мг/л до 10 г/л) и предпочтительно в диапазоне от 1 част. на миллион до 3000 част. на миллион (от 1 мг/л до 3 г/л).

С помощью фунгицидов настоящего изобретения, которые применяют в сельском хозяйстве или садоводстве, можно вести борьбу с болезнями растений, вызванными патогенными грибами из Oomycetes, Ascomycetes, Deuteromycetes и Basidiomycetes. Далее перечислены примеры грибов, которые не ограничиваются лишь этими грибами: Pseudoperonospora, например грибки-возбудители ложной мучнистой росы (Pseudoperonospora cubensis), Sphaerotheca, например грибки-возбудители настоящей мучнистой росы (Sphaerotheca fuliginea), Venturia, например грибки-возбудители парши яблони (Venturia inaequalis), Pyricularia, например грибки-возбудители пирикулярриоза риса (Pyricularia oryzae), Gibberella, например грибки-возбудители болезни "Bakanae" (Gibberella fujikuroi), Botrytis, например грибки-возбудители серой плесени (Botrytis cinerea), Alternaria, например грибки-возбудители пятнистости горчицы сапентской (Alternaria brassicicola), Rhizoctonia, например грибки-возбудители гнили зерновых чешуек риса (Rhizoctonia solani) и Puccinia, например грибки-возбудители ржавчины (Puccinia recondita).

Кроме того, соединения в соответствии с изобретением можно применять по

отдельности или в комбинации с другими фунгицидами, инсектицидами, гербицидами, модификаторами роста растений, удобрениями или подобными веществами. Далее представлены типичные примеры составов препаратов, в которых все "%" представляют собой проценты по весу.

Пример состава 1: Тонкодисперсный порошок

2% Соединения А-1, 5% диатомовой земли и 93% глины однородно смешивают и измельчают в тонкодисперсный порошок.

Пример состава 2: Смачивающийся порошок

50% Соединения А-7, 45% диатомовой земли, 2% динафтилметандисульфоната натрия и 3% лигнинсульфоната натрия однородно смешивают и измельчают в смачивающийся порошок.

Пример состава 3: Концентрат эмульсии
30% Соединения А-12, 20% циклогексана, 11% алкиларилового эфира полиоксиэтилена, 4% алкилбензолсульфоната кальция и 35% метилнафталина однородно эмульгируют, получая при этом концентрат эмульсии.

Пример состава 4: Гранулы

5% Соединения В-5, 2% натриевой соли сернокислого эфира лаурилового спирта, 5% лигнинсульфоната натрия, 2% карбоксиметилцеллюлозы и 86% глины смешивают и измельчают. К измельченной смеси добавляют воду в количестве 20% в расчете на общий вес измельченной смеси. Полученную смесь перемешивают и формируют в гранулы размером от 14 меш до 32 меш посредством экструзионного гранулятора и затем сушат для образования желательных гранул.

Далее со ссылкой на примеры испытаний будут объяснены действия, оказываемые фунгицидами для сельского хозяйства или садоводства в соответствии с настоящим изобретением. В примерах испытаний в качестве сравнительного соединения использован N-(1-циано-1,2-диметилпропил)-2-(пиримидин-2-илокси)пропионамид, раскрытый в заявке на патент Японии, первая публикация N Sho. 63-132867.

Пример испытаний 1

Испытание профилактического действия фунгицидов на пирикулярриоз риса (Pyricularia oryzae)

Семена культуры риса (сорт: Aichi Asahi) засевают в фарфоровые горшочки диаметром 7 см при норме высева 15 зерен на каждый горшочек. В теплице обеспечивают проращивание семян и их рост в течение времени от 2 до 3 недель. Смачивающийся порошок, приготовленный в соответствии с примером состава 2, разбавляют водой до концентрации активного ингредиента 500 част. на миллион и затем полученным водным препаратом опрыскивают всходы риса на стадии развития 4-го листа при норме расхода 10 мл/горшочек. После высушивания на воздухе всходы инокулируют путем опрыскивания конидиоспорной суспензией грибов-возбудителей пирикулярриоза риса (Pyricularia oryzae) и сразу же помещают на 24 часа во влажную камеру при 25°C и затем в теплицу. На пятый день после инокуляции подсчитывают количество повреждений на 4-м листе. В соответствии с уравнением 1

вычисляют степень активности в борьбе с грибами-возбудителями болезней. Результаты оценки, полученные в соответствии со стандартом оценок, показанным в таблице 17, приведены в таблицах 18-21.

Уравнение 1

$$\text{Степень активности подавления (\%)} = \left[1 - \frac{\text{Количество повреждений на обработанной препаратом делянке}}{\text{Количество повреждений на контрольной делянке}} \right] \times 100$$

Пример испытаний 2

Испытание применения в условиях затопления на пирикулярриоз риса (*Pyricularia oryzae*).

Семена культуры риса (сорт: Aichi Asahi) на фазе развития 1,5 листа пересекают в 4 положения в белых фарфоровых горшочках диаметром 9 см при норме посева 3 проростка на каждое местоположение в горшочке. В теплице обеспечивают проращивание семян и их рост. Когда всходы вырастут и достигнут фазы развития 2,5 листьев, в ирригационную воду, находящуюся в горшочках, вносят приготовленные в соответствии с примером состава 2 смачивающиеся порошки с тем, чтобы концентрация активного ингредиента составила 300 г/10 ар. Через 10 дней после обработки всходы инокулируют путем опрыскивания конидиоспорной суспензией грибов-возбудителей пирикулярриоза риса (*Pyricularia oryzae*) и сразу же помещают на 24 часа во влажную камеру при 25°C и затем в теплицу с тем, чтобы вызвать заболевание. На пятый день после инокуляции подсчитывают количество повреждений на листе, который во время инокуляции находится на наиболее зрелой стадии роста. В соответствии с Уравнением 1 вычисляют степень активности подавления. Результаты оценки, полученные в соответствии со стандартом оценок, показанным в таблице 17, приведены в таблицах 22-23.

Испытание превентивного действия в отношении мучнистой росы пшеницы

9 Семян пшеницы (сорт: Norin-61-go) высевали каждое в отдельный поливинилхлоридный горшок 9 см x 9 см, выращивали в теплице в течение 8 дней, затем обрабатывали водными растворами смачивающихся порошков по 10 мл на горшок, приготовленных в соответствии с составом Примера 2 в концентрации активных ингредиентов 500 ч/млн и сушили на воздухе. Затем проростки инокулировали спорами *Erysiphe graminis*, находящимися в суспензии, и помещали в теплицу при температуре 25-30 °C. Через 10 дней после инокуляции наблюдали общую зараженную площадь первых листьев в каждом горшке и оценивали в соответствии со стандартами, указанными в таблице А. Результаты представлены в таблице В.

Испытание превентивного действия в

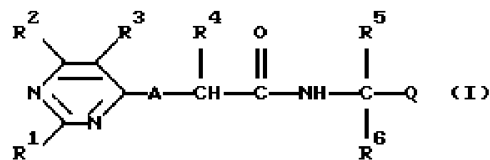
отношении парши яблони

5 Семян яблони (сорт: Kogyoku) высевали каждое в отдельный поливинилхлоридный горшок 9 см x 9 см, выращивали в теплице в течение 20 дней. Ростки яблони с 4-мя листьями обрабатывали водными растворами смачивающихся порошков по 20 мл на горшок, приготовленными в соответствии с составом Примера 2 при концентрации активных ингредиентов 500 ч/млн и сушили на воздухе. Затем проростки инокулировали спорами *Venturia inaequalis*, находящимися в суспензии, и помещали на 48 часов во влажную камеру при температуре 22°C. Затем проростки помещали в теплицу для развития заболевания. Через 14 дней после инокуляции наблюдали общую зараженную площадь верхних двух из зараженных листьев и оценивали в соответствии со стандартами, указанными в Таблице А. Результаты представлены в Таблице С.

Формула изобретения:

1. Производное

пиримидинилоксиалканамида, представленное формулой (I)



где R¹ представляет собой атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу, C₁-C₄ галогеналкильную группу, C₁-C₆ алкоксигруппу, C₂-C₆ алкенилоксигруппу, C₂-C₆ алкинилоксигруппу, C₃-C₆ циклоалкилоксигруппу, C₁-C₆ алкилтиогруппу, C₁-C₆ алкилсульфинильную группу, C₁-C₆ алкилсульфонильную группу, C₂-C₆ алкенилтиогруппу, C₂-C₆ алкинилтиогруппу, C₃-C₆ циклоалкилтиогруппу, атом галогена, фенильную группу, которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой или атомом галогена, или феноксигруппу, которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой или атомом галогена;

R² представляет собой атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу, C₂-C₆ алкенильную группу, C₂-C₆ алкинильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу, C₁-C₄ галогеналкильную группу, C₂-C₆ галогеналкенильную группу, C₁-C₆ алкоксигруппу, C₂-C₆ алкенилоксигруппу, C₂-C₆ алкинилоксигруппу, C₃-C₆ циклоалкилоксигруппу, C₁-C₄ галогеналкоксигруппу, C₁-C₆ алкилтиогруппу, C₂-C₆ алкенилтиогруппу,

C₂-C₆ алкилтиогруппу, атом галогена или фенильную группу, которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой или атомом галогена;

R³ представляет собой атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу, C₁-C₄ галогеналкильную группу, C₁-C₆ алкоксигруппу, (C₁-C₆ алкил)карбонильную группу, (C₁-C₆ алкокси)карбонильную группу, атом галогена, нитрогруппу или цианогруппу,

или R² и R³ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют ненасыщенное 5-членное или 6-членное кольцо;

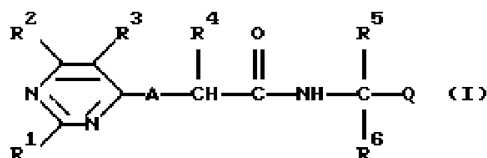
R⁴ представляет собой атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу или C₁-C₄ галогеналкильную группу;

R⁵ и R⁶ независимо представляют собой атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу, C₂-C₆ алкенильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу, которая может быть замещена атомом галогена или C₁-C₆ алкильной группой, C₃-C₆ циклоалкил C₁-C₆ алкильную группу, C₁-C₆ алкокси C₁-C₆ алкильную группу или C₁-C₄ галогеналкильную группу, R⁵ и R⁶ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют 5-членную ~ 7-членную циклоалкильную группу, которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, или 5-членную или 6-членную гетероциклическую группу, содержащую атом кислорода или атом серы в качестве гетероатома, которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой;

Q представляет собой цианогруппу или группу формулы -COR⁷, где R⁷ представляет собой C₁-C₆ алкильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу, которая может быть замещена атомом галогена или C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильную группу, C₁-C₆ алкоксигруппу, C₂-C₆ алкенилоксигруппу, C₂-C₆ алкинилоксигруппу или C₃-C₆ циклоалкилоксигруппу;

A представляет собой атом кислорода или атом серы.

2. Производное пиримидинилоксиалканамида, представленное формулой (I)



где R¹ представляет собой атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу, C₁-C₄ галогеналкильную группу, C₁-C₆ алкоксигруппу, C₂-C₆ алкенилоксигруппу,

C₂-C₆ алкинилоксигруппу, C₃-C₆ циклоалкилоксигруппу, C₁-C₆ алкилтиогруппу, C₁-C₆ алкилсульфинильную группу, C₁-C₆ алкилсульфонильную группу, C₂-C₆ алкенилтиогруппу, C₂-C₆ алкилтиогруппу, C₃-C₆ циклоалкилтиогруппу, атом галогена, фенильную группу, которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой или атомом галогена, или феноксигруппу, которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой или атомом галогена;

R² представляет собой C₁-C₆ алкильную группу, C₂-C₆ алкенильную группу, C₂-C₆ алкинильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу, C₁-C₄ галогеналкильную группу, C₂-C₆ галогеналкенильную группу, C₁-C₆ алкоксигруппу, C₂-C₆ алкенилоксигруппу, C₂-C₆ алкинилоксигруппу, C₃-C₆ циклоалкилоксигруппу, C₁-C₄ галогеналкоксигруппу, C₁-C₆ алкилтиогруппу, C₂-C₆ алкенилтиогруппу, C₂-C₆ алкилтиогруппу или атом галогена;

R³ представляет собой атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу, C₁-C₄ галогеналкильную группу, C₁-C₆ алкоксигруппу, атом галогена или цианогруппу,

или R² и R³ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют ненасыщенное 5-членное или 6-членное кольцо,

R⁴ представляет собой атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу или C₃-C₆ циклоалкильную группу,

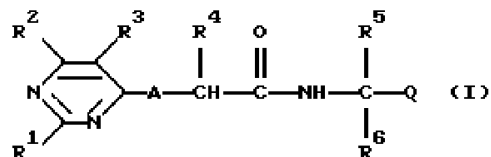
R⁵ и R⁶ независимо представляют собой атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу, C₂-C₆ алкенильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу, которая может быть замещена атомом галогена или C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₆ алкокси C₁-C₆ алкильную группу или C₁-C₄ галогеналкильную группу, R⁵ и R⁶ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют 5-членную ~ 7-членную циклоалкильную группу, которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, или 5-членную или 6-членную гетероциклическую группу, содержащую атом кислорода или атом серы в качестве гетероатома, которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой;

Q представляет собой цианогруппу или группу формулы -COR⁷, где R⁷ представляет собой C₁-C₆ алкильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу, которая может быть замещена атомом галогена или

C₁-C₆ алкильной группой,
C₁-C₄ галогеналкильную группу,
C₁-C₆ алкоксигруппу,
C₂-C₆ алкенилоксигруппу,
C₂-C₆ алкинилоксигруппу или
C₃-C₆ циклоалкилоксигруппу;

A представляет собой атом кислорода или атом серы.

3. Производное пиримидинилоксиалканамида, представленное формулой (I)



где R¹ представляет собой атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу, C₁-C₄ галогеналкильную группу, C₁-C₆ алкоксигруппу, C₁-C₆ алкилтиогруппу, C₂-C₆ алкенилтиогруппу, C₂-C₆ алкинилтиогруппу, атом галогена, фенильную группу или феноксигруппу;

R² представляет собой C₁-C₆ алкильную

группу, C₁-C₄ галогеналкильную группу, C₁-C₆ алкоксигруппу, C₁-C₆ алкилтиогруппу или атом галогена;

R³ представляет собой атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу или атом галогена,

R⁴ представляет собой атом водорода или C₁-C₆ алкильную группу;

R⁵ и R⁶ независимо представляют собой атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу или C₁-C₄ галогеналкильную группу, R⁵ и R⁶ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют 5-членную ~ 7-членную циклоалкильную группу, которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой,

Q представляет собой цианогруппу или группу формулы -COR⁷, где R⁷ представляет собой C₁-C₆ алкильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу или C₁-C₆ алкоксигруппу;

A представляет собой атом кислорода или атом серы.

4. Фунгицид для сельского хозяйства или садоводства, включающий в качестве активного ингредиента производное пиримидинилоксиалканамида по пп. 1, 2 или 3.

30

35

40

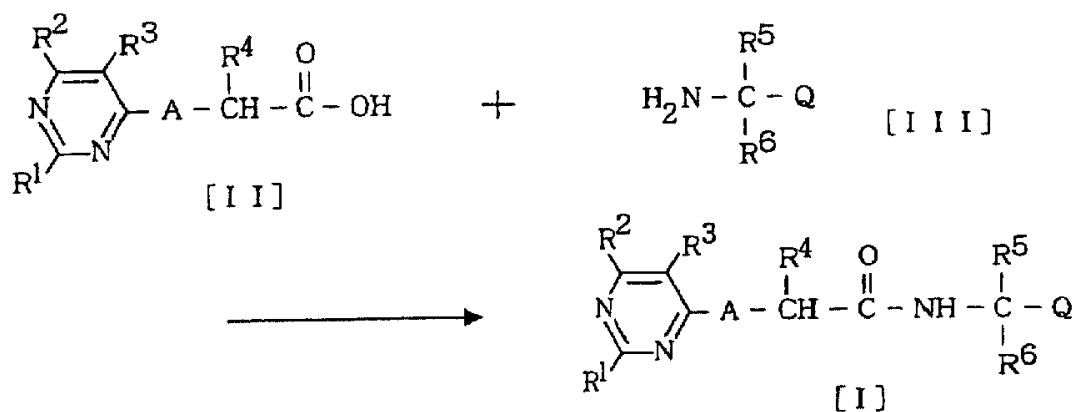
45

50

55

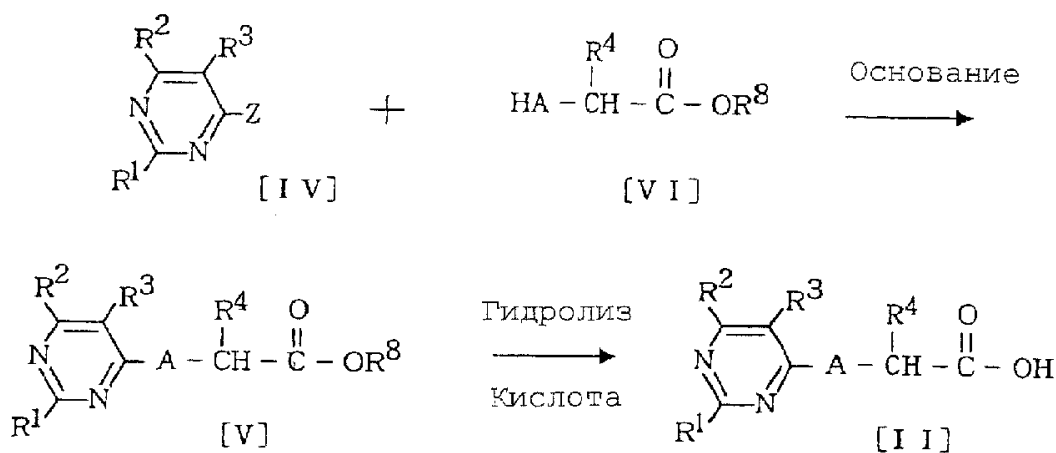
60

Схема 1



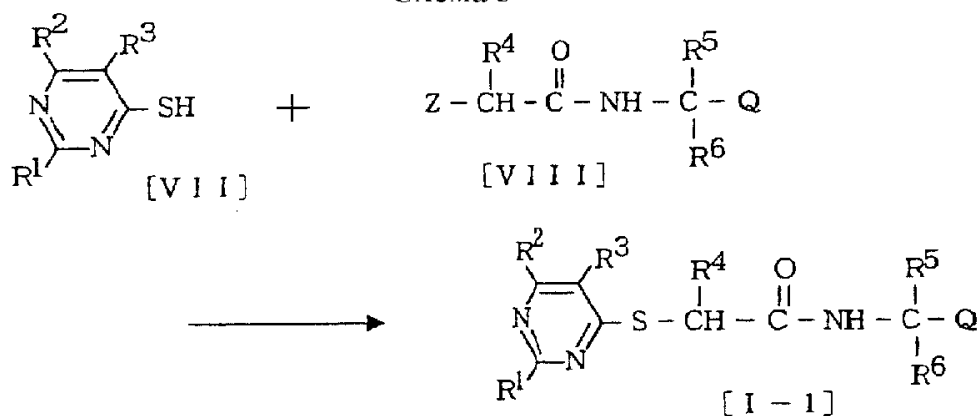
где R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , Q и A имеют те же самые значения, которые были определены выше.

Схема 2



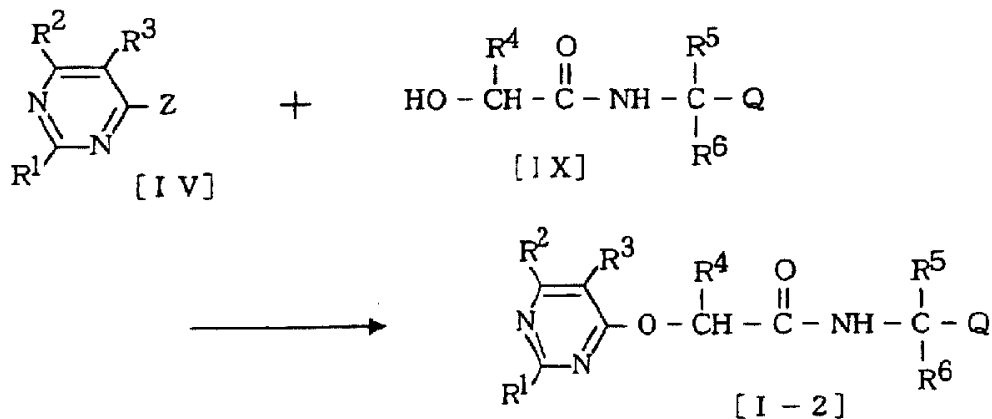
где R^1 , R^2 , R^3 , R^4 и A имеют такие же значения, которые были определены выше, R^8 представляет собой C_1 - C_6 алкильную группу и Z представляет собой отщепляемую группу, например, атом галогена или подобную группу.

Схема 3



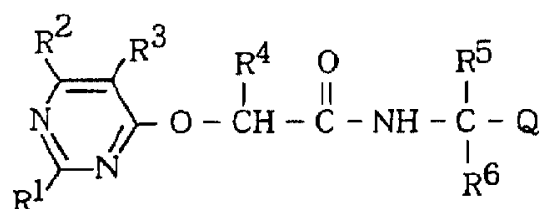
где R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , Q и Z имеют такие же значения, которые были определены выше.

Схема 4



где R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , Q и Z имеют такие же значения, которые были определены выше.

Таблица 1



Соединение №	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Q	Температура плавления (°C) или показатель преломления (n _D ²⁰)	Изомер
A-1	H	Me	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	115~117	M
A-2	H	Me	Cl	Me	Me	Me	CN		
A-3	H	Et	CF ₃	H	Me	i-Pr	CN		
A-4	H	Et	F	Me	Me	i-Pr	CN		
A-5	H	Et	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	129~131	M
A-6	H	Et	Cl	Me	Et	Et	CN	133~134	
A-7	H	Et	Cl	H	Me	i-Pr	CN	1.5166	
A-8	H	Et	Cl	H	Me	CH ₂ OMe	CN		
A-9	H	Et	Br	Me	Me	i-Pr	CN		
A-10	H	Et	I	Me	Me	i-Pr	CN		
A-11	H	Et		H	Me	i-Pr	CN		
A-12	H	Et	H	Me	Me	t-Bu	CN	140~142	M
A-13	H	Et	Me	Me	Me	i-Pr	CN	148~150	M
A-14	H	H	Cl	Me	Me	i-Pr	CN		
A-15	H	i-Pr	H	Me	Me	i-Pr	CN	89~90	M
A-16	H	i-Pr	H	Me	Me	t-Bu	CN	95~97	M
A-17	H	i-Pr	Cl	Me	H	i-Pr	CN		
A-18	H	i-Pr	Cl	Me	H	t-Bu	CN	165~168	M
A-19	H	i-Pr	Cl	Me	H	i-Pr	COOMe		
A-20	H	i-Pr	Cl	Me	H	t-Bu	COOMe		
A-21	H	i-Pr	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	132~134	M
A-22	H	i-Pr	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	87~89	M
A-23	H	i-Pr	Cl	Me	s-Bu	Me	CN		
A-24	H	i-Pr	Cl	Me			CN		
A-25	H	i-Pr	Cl	Me	Me	i-Pr	COOMe	1.4987	M
A-26	H	i-Pr	Cl	Me	Me	t-Bu	COOMe	1.5029	M
A-27	H	n-Pr	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	108~110	N

Таблица 2

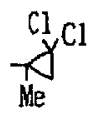
Соединение №	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Q	Температура плавления (°C) или показатель преломления (n _D ²⁰)	Изомер
A-28	H	n-Pr	Cl	Me	Et	Et	CN	95~97	
A-29	H		Cl	H	Me	i-Pr	CN		
A-30	H	CH=CH ₂	Cl	H	Me	i-Pr	CN		
A-31	H	SMe	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	150~151	M
A-32	H	OMe	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	140~142	M
A-33	H		Cl	H	Me	i-Pr	CN		
A-34	H	OCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Me	i-Pr	CN		
A-35	H	OCH ₂ C≡CH	Cl	H	Me	i-Pr	CN		
A-36	H	Cl	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	128~131	M
A-37	H	Cl	Cl	Me	Me	i-Pr	COOMe		
A-38	H	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN	137~139	M
A-39	H	CF ₃	Me	Me	Me	i-Pr	CN	149~151	M
A-40	H	CF ₃	Me	Me	Et	Et	CN	149~151	
A-41	H	CF ₃	Me	Me	Me	t-Bu	CN	150~153	A
A-42	H	CF ₃	Me	Me	Me	t-Bu	CN	125~128	B
A-43	H	CF ₃	Me	Me	Me	CHCl ₂	CN	185~188	M
A-44	H	CF ₃	Me	Me	Me		CN	131~134	M
A-45	H	CF ₃	Me	Me	Me		CN		
A-46	H	CF ₃	Me	Me	Me		CN		
A-47	H	CF ₃	Me	Me	Me		CN		
A-48	H	CF ₃	Me	H	Me	i-Pr	COOMe		
A-49	H	CF ₃	Me	Me	Me	i-Pr	COOMe	74~75	M
A-50	H	CF ₃	Me	Me	H	i-Pr	COOMe		
A-51	H	CF ₃	Me	CF ₃	H	i-Pr	COOMe		
A-52	H	CF ₃	Me	Me	H	i-Pr	COOCH ₂ CH=CH ₂		
A-53	H	CF ₃	Me	Me	H	t-Bu	CN		
A-54	H	CF ₃	Et	Me	Me	i-Pr	CN	140~141	A
A-55	H	CF ₃	Et	Me	Me	i-Pr	CN	149~150	B

Таблица 3

Соединение №	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Q	Температура плавления (°C) или показатель преломления (n _D ²⁰)	Изомер
A-56	H	CF ₃	Et	Me	Me	i-Pr	COO- 		
A-57	H	CF ₃	F	H	Me	i-Pr	CN		
A-58	H	CF ₃	Cl	H	Me	i-Pr	CN	1.4871	
A-59	H	CF ₃	Cl	H	Me	t-Bu	CN	156~157	
A-60	H	CF ₃	Cl	H	Et	Et	CN		
A-61	H	CF ₃	Cl	Me	Me	Me	CN	148~151	
A-62	H	CF ₃	Cl	Me	Me	Et	CN	141~144	M
A-63	H	CF ₃	Cl	Me	Me	n-Pr	CN	106~109	M
A-64	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	157~159	A
A-65	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	126~129	B
A-66	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	149~150	M
A-67	H	CF ₃	Cl	Me	Me	CH ₂ - 	CN		
A-68	H	CF ₃	Cl	Me	Me		CN	124~125	A
A-69	H	CF ₃	Cl	Me	Me		CN	128~130	B
A-70	H	CF ₃	Cl	Me	Me		CN	114~116	M
A-71	H	CF ₃	Cl	Me	Me		CN	130~133	A
A-72	H	CF ₃	Cl	Me	Me		CN	134~137	B
A-73	H	CF ₃	Cl	Me	Me		CN	107~109	M
A-74	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Bu	CN	91~93	M
A-75	H	CF ₃	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	155~157	A
A-76	H	CF ₃	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	129~132	B
A-77	H	CF ₃	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	134~136	M
A-78	H	CF ₃	Cl	Me	Et	Et	CN	153~154	
A-79	H	CF ₃	Cl	Me			CN	125~128	
A-80	H	CF ₃	Cl	Me			CN	172~174	
A-81	H	CF ₃	Cl	Me		Me	CN	170~172	M
A-82	H	CF ₃	Cl	Me		Me	CN	141~143	

Таблица 4

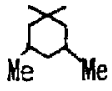
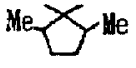
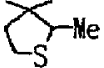
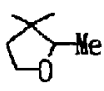
Соединение №	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Q	Температура плавления (°C) или показатель преломления (n _D ²⁰)	Изомер
A-83	H	CF ₃	Cl	Me			CN	160~162	
A-84	H	CF ₃	Cl	Me			CN		
A-85	H	CF ₃	Cl	Me			CN		
A-86	H	CF ₃	Cl	Me			COOMe		
A-87	H	CF ₃	Cl	Me			COOMe		
A-88	H	CF ₃	Cl	Me			CN	214~216	
A-89	H	CF ₃	Cl	Me			CN	180~183	M
A-90	H	CF ₃	Cl	Me			CN	174~177	M
A-91	H	CF ₃	Cl	Me	H	t-Bu	CN	188~190	M
A-92	H	CF ₃	Cl	Me	H	s-Bu	CN		
A-93	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	COOMe	85~86	M
A-94	H	CF ₃	Cl	Me	H	i-Pr	COOMe	106~108	M
A-95	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	COOEt	1.4765	M
A-96	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	COO-i-Pr	1.4701	M
A-97	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	COOCH ₂ C≡CH		
A-98	H	CF ₃	Cl	Et	Me	i-Pr	CN	154~156	A
A-99	H	CF ₃	Cl	Et	Me	i-Pr	CN	116~118	B
A-100	H	CF ₃	Cl	Et	Me	i-Pr	CN	139~142	M
A-101	H	CF ₃	Cl	Et	Me	t-Bu	CN	106~109	M
A-102	H	CF ₃	Cl	Et	Me	s-Bu	CN		
A-103	H	CF ₃	Cl	n-Pr	Me	i-Pr	CN		

Таблица 5

Соединение №	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Q	Температура плавления (°C) или показатель преломления (n _D ²⁰)	Изомер
A-104	H	CH(Cl)Me	Cl	H	Me	i-Pr	CN		
A-105	H	CH(Cl)Me	Cl	Me	Me	i-Pr	CN		
A-106	H	CH(Cl)Me	Cl	Me	Me	t-Bu	CN		
A-107	H	CH(Cl)Me	Cl	Me	Me	i-Pr	COOMe		
A-108	H	CH(Cl)Me	Cl	Me	Me	t-Bu	COOMe		
A-109	H	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CN	176~177	A
A-110	H	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CN	163~164	B
A-111	H	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CN	153~154	M
A-112	H	CF ₃	Br	Me	Me	t-Bu	CN	170~171	A
A-113	H	CF ₃	Br	Me	Me	t-Bu	CN	168~170	B
A-114	H	CF ₃	Br	Me	Me	t-Bu	CN	147~149	M
A-115	H	CF ₃	Br	Me	H	t-Bu	CN		
A-116	H	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	COOMe	110~111	M
A-117	H	CF ₃	I	Me	Me	i-Pr	CN		
A-118	H	CF ₃	CN	Me	Me	t-Bu	CN		
A-119	H	Ph	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-120	H	NHPr-i	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-121	H	N(Me) ₂	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-122	H	NHPr-i	Cl	Me	Me	i-Pr	CN		
A-123	H	N(Me) ₂	Cl	Me	Me	i-Pr	CN		
A-124	H	CF ₃	OMe	Me	Me	t-Bu	CN		
A-125	H	-CH=CH-CH=CH-		Me	Me	i-Pr	CN	139~141	M
A-126	H	-(CH ₂) ₄ -		Me	Me	t-Bu	CN		
A-127	H	-(CH ₂) ₃ -		Me	Me	t-Bu	CN		
A-128		CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	131~132	A
A-129		CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	128~130	M
A-130		CF ₃	Cl	Me	Et	i-Pr	CN		
A-131	Cl	OMe	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-132	Cl	SMe	H	Me	Me	i-Pr	CN	1.5381	M
A-133	CF ₃	Me	Cl	Me	Me	i-Pr	CN		
A-134	CF ₃	Et	Me	Me	Me	i-Pr	CN		

Таблица 6

Соединение №	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Q	Температура плавления (°C) или показатель преломления (n _D ²⁰)	Изомер
A-135	Me	Me	NO ₂	Me	Me	i-Pr	CN	140~143 1.5021	М
A-136	Me	Et	i-Pr	Me	Me	i-Pr	CN		
A-137	Me	Et	i-Pr	Me	Me	t-Bu	CN		
A-138	Me	C≡CMe	H	Me	Me	t-Bu	CN		
A-139	Me	CH=CHMe	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-140	Me	CH=C(Cl)Me	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-141	Me	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN	111~113	A
A-142	Me	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN	1.4672	B
A-143	Me	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN	1.4710	М
A-144	Me	CF ₃	H	Me	Me	t-Bu	CN	120~122	A
A-145	Me	CF ₃	H	Me	Me	t-Bu	CN	135~137	B
A-146	Me	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	COOMe	130~132 154~156 133~134 137~139 135~137	A B A B
A-147	Me	CF ₃	Cl	H	Me	i-Pr	CN		
A-148	Me	CF ₃	Cl	Me	H	t-Bu	CN		
A-149	Me	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN		
A-150	Me	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN		
A-151	Me	CF ₃	Cl	Me	Me	t-Bu	CN		
A-152	Me	CF ₃	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	137~139	B
A-153	Me	CF ₃	Cl	Me	Et	Et	CN	135~137	
A-154	Me	CF ₃	Cl	Me			CN		
A-155	Me	CF ₃	Cl	Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	COOEt		
A-156	Me	CF ₃	Cl	Me			CN	189~191	
A-157	Me	CF ₃	Cl	Me			CN	122~125	М
A-158	Me	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	COOMe	122~125	М
A-159	Me	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	COOEt	1.4778	М
A-160	Me	CF ₃	Cl	Et	Me	i-Pr	CN		
A-161	Me	CF ₃	Cl		Me	i-Pr	CN		
A-162	Me	Ph	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-163	Me	Ph(4-Cl)	H	Me	Me	i-Pr	CN		

Таблица 7

Соединение №	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Q	Температура плавления (°C) или показатель преломления (nD ²⁰)	Изомер
A-164	Me	Ph(4-Me)	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-165	Me	Ph(4-OMe)	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-166	Me	CF ₃	Me	Me	Me	i-Pr	CN	105~108	A
A-167	Me	CF ₃	Me	Me	Me	i-Pr	CN	172~175	B
A-168	Me	CF ₃	Me	Me	Me	t-Bu	CN	128~129	A
A-169	Me	CF ₃	Me	Me	Me	t-Bu	CN	131~132	B
A-170	Me	CF ₃	Me	H	Me	i-Pr	CN		
A-171	Me	CF ₃	Me	H	Me	t-Bu	CN		
A-172	i-Pr	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN	131~134	M
A-173	t-Bu	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-174	OCH ₂ C≡CH	Me	Cl	Me	Me	i-Pr	CN		
A-175	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	Cl	Me	Me	i-Pr	CN		
A-176	OMe	CF ₃	Me	Me	Me	i-Pr	CN	Не определ.	M
A-177	OMe	SMe	H	Me	Me	i-Pr	CN	Не определ.	M
A-178	O- 	Me	Cl	Me	Me	i-Pr	CN		
A-179	NH-i-Pr	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-180	N(Me) ₂	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-181	Ph	Me	COMe	Me	Me	i-Pr	CN		
A-182	Ph	Me	COOMe	Me	Me	i-Pr	CN		
A-183	Ph	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN	152~154	M
A-184	Ph	CF ₃	H	Me	Me	t-Bu	CN	155~157	M
A-185	Ph	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	COOMe		
A-186	Ph(2-Cl)	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-187	Ph(3-CN)	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-188	Ph(3-Me)	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-189	Ph(3-NO ₂)	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-190	Ph(4-CF ₃)	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-191	Ph(4-OMe)	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-192	SMe	Me	H	Me	Me	i-Pr	CN	106~108	M
A-193	SMe	Et	H	Me	Me	i-Pr	CN	106~108	M
A-194	SMe	Et	H	Me	Me	t-Bu	CN	108~110	M

Таблица 8

Соединение №	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Q	Температура плавления (°C) или показатель преломления (n _D ²⁰)	Изо- мер
A-195	SMe	Et	Me	Me	Me	i-Pr	CN	105~107	M
A-196	SMe	Et	Me	Me	Me	t-Bu	CN	1.5303	M
A-197	SMe	Et	Me	Me	Me	i-Pr	COMe		
A-198	SMe	Et	Me	Me	Me	i-Pr	COOMe		
A-199	SMe	Et	Et	Me	Me	i-Pr	CN	136~138	M
A-200	SMe	Et	Et	Me	Me	t-Bu	CN	77~ 78	M
A-201	SMe	Et	i-Pr	Me	Me	i-Pr	CN	134~136	M
A-202	SMe	Et	i-Pr	Me	Me	t-Bu	CN	84~ 85	M
A-203	SMe	i-Pr	H	Me	Me	i-Pr	CN	99~102	M
A-204	SMe	i-Pr	H	Me	Me	i-Pr	COOMe	57~ 60	M
A-205	SMe	i-Pr	H	Me	Me	i-Pr	COOMe	75~ 77	B
A-206	SMe	i-Pr	H	Me		Me	CN		
A-207	SMe	i-Pr	H	Me			CN		
A-208	SMe	i-Pr	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	120~122	M
A-209	SMe	i-Pr	Cl	Me	Me	t-Bu	CN		
A-210	SMe	i-Pr	Cl	Me	Me	i-Pr	COOMe	41~ 43	M
A-211	SMe	i-Pr	Cl	Me	Et	i-Pr	CN		
A-212	SMe	i-Pr	Cl	Me	Et	Et	CN		
A-213	SMe	i-Pr	Cl	Me			CN		
A-214	SMe	n-Pr	H	Me	Me	i-Pr	CN	130~132	M
A-215	SMe	n-Pr	H	Me	Me	t-Bu	CN	95~ 97	M
A-216	SMe	C (Me) ₂ Cl	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	132~135	M
A-217	SMe	C (Me) ₂ Cl	Cl	Me	Me	t-Bu	CN		
A-218	SMe	C (Me) ₂ Cl	Cl	Me	Me	i-Pr	COOMe		
A-219	SMe	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN	110~113	M
A-220	SMe	CF ₃	H	Me	Me	t-Bu	CN	108~110	M
A-221	SMe	CF ₃	H	Me	Me		CN		
A-222	SMe	CF ₃	H	H	Me	t-Bu	CN		
A-223	SMe	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	114~116	M
A-224	SMe	CF ₃	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	131~133	M
A-225	SMe	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	COOMe	1.5093	M

Таблица 9

Соединение №	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Q	Температура плавления (°C) или показатель преломления, (nD ²⁰)	Изо- мер
A-226	SMe	CF ₃	Cl	Me	Me	t-Bu	COOMe	110~112 78~ 80 Не определ.	M
A-227	SMe	CF ₃	Me	Me	Me	i-Pr	CN		
A-228	SMe	CF ₃	Me	Me	Me	t-Bu	CN		
A-229	SMe	CF ₃	Me	Me	Me	i-Pr	COOMe		
A-230	SMe	Cl	H	Me	Me	t-Bu	CN		
A-231	SMe	OMe	H	Me	Me	t-Bu	CN		
A-232	SMe	OCHF ₂	H	Me	Me	t-Bu	CN		
A-233	SMe	SCH ₂ C≡CH	H	Me	Me	t-Bu	CN		
A-234	SMe	SCH ₂ CH=CH ₂	H	Me	Me	t-Bu	CN		
A-235	SMe	SMe	H	Me	Me	t-Bu	CN		
A-236	SO ₂ Me	CF ₃	Me	Me	Me	i-Pr	CN	68~ 70	M
A-237	SEt	Et	Et	Me	Me	i-Pr	CN	97~ 99	M
A-238	SEt	Et	Et	Me	Me	t-Bu	CN	64~ 66	M
A-239	SEt	Et	i-Pr	Me	Me	i-Pr	CN	118~119	M
A-240	SEt	Et	i-Pr	Me	Me	t-Bu	CN	107~108	M
A-241	SEt	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN	104~105	M
A-242	SEt	CF ₃	H	Me	Me	t-Bu	CN	88~ 90	M
A-243	SEt	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	COOMe	72~ 74 112~114 99~100 69~ 71 108~110 96~ 98 96~ 98 120~122 107~109	M
A-244	SEt	CF ₃	H	Me	Me	t-Bu	COOMe		
A-245	S- 	Me	Cl	Me	Me	i-Pr	CN		
A-246	S-i-Pr	Et	Et	Me	Me	i-Pr	CN		
A-247	S-i-Pr	Et	i-Pr	Me	Me	i-Pr	CN		
A-248	S-i-Pr	Et	i-Pr	Me	Me	t-Bu	CN		
A-249	S-i-Pr	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-250	S-i-Pr	CF ₃	H	Me	Me	t-Bu	CN		
A-251	SCH ₂ CH=CH ₂	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-252	SCH ₂ CH=CH ₂	CF ₃	H	Me	Me	t-Bu	CN		
A-253	SCH ₂ C≡CH	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-254	SCH ₂ C≡CH	CF ₃	H	Me	Me	t-Bu	CN		

Таблица 10

Соединение №	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Q	Температура плавления (°C) или показатель преломления (n _D ²⁰)	Изомер
A-255	H	CF ₂ Cl	Br	Me	Me	i-Pr	CN	162~164	M
A-256	H	CF ₂ Cl	Br	Me	Me	t-Bu	CN	141~142	A
A-257	H	CF ₂ Cl	Br	Me	Me	t-Bu	CN	140~142	B
A-258	H	CF ₂ Cl	Br	Me	Me	t-Bu	CN	121~124	M
A-259	H	CF ₂ Cl	Br	Me	Me	i-Pr	COMe	156~159	M
A-260	H	CF ₂ Cl	Br	Me	Et	Et	COMe	177~180	
A-261	H	CF ₂ Cl	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	165~166	A
A-262	H	CF ₂ Cl	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	165~167	B
A-263	H	CF ₂ Cl	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	158~160	M
A-264	H	CF ₂ Cl	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	134~136	A
A-265	H	CF ₂ Cl	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	118~120	B
A-266	H	CF ₂ Cl	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	111~114	M
A-267	H	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CN	148~151	RA
A-268	H	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CN	125~126	RB
A-269	H	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CN	123~125	RM
A-270	H	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	COMe	143~144	M
A-271	H	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	COEt		
A-272	H	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CO 		
A-273	H	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	COCF ₃		
A-274	H	CF ₃	Cl	Me	Et	i-Pr	CN	138~141	M
A-275	H	CF ₃	Cl	Me	Me		CN	113~114	M
A-276	H	CF ₃	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	117~118	RA
A-277	H	CF ₃	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	120~123	RB
A-278	H	CF ₃	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	115~116	SA
A-279	H	CF ₃	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	118~121	SB
A-280	H	CF ₃	Cl	Et	Me	t-Bu	CN	123~124	A
A-281	H	CF ₃	Cl	Et	Me	t-Bu	CN	106~109	M
A-282	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	155~158	RA
A-283	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	84~85	RB
A-284	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	111~114	RM
A-285	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	150~153	SA

Таблица 11

Соединение №	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Q	Температура плавления (°C) или показатель преломления (n _D ²⁰)	Изомер
A-286	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	94~96	SB
A-287	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	104~106	SM
A-288	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	COMe	151~154	M
A-289	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	COPr-n		
A-290	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	COCH ₂ Cl		
A-291	H	CF ₃	Cl	Me	Et	Et	COMe	170~172	
A-292	H	CF ₃	Cl	Me	Me	Et	COMe	178~181	M
A-293	H	CF ₃	Cl	Me	Me	Me	COMe	201~203	
A-294	H	CF ₃	Me	Me	Me	t-Bu	CN	108~110	RA
A-295	H	CF ₃	Me	Me	Me	t-Bu	CN	109~112	RB
A-296	H	CF ₃	Me	Me	Me	i-Pr	COMe	120~123	M
A-297	H	CF ₃	Me	Me	Me	Et	COMe	155~158	M
A-298	H	CF ₃	Me	Me	Et	Et	COMe	141~144	
A-299	Me	CF ₃	Me	Me	Me	i-Pr	COMe	114~117	M
A-300	Me	CF ₃	Me	Me	Me	Et	COMe	138~141	M
A-301	Me	CF ₃	Me	Me	Et	Et	COMe	95~98	
A-302	H	CHBr ₂	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	54~57	M
A-303	H	CHBr ₂	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	155~158	M
A-304	H	CHCl ₂	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	160~162	M
A-305	H	CHCl ₂	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	152~154	M
A-306	H	CHF ₂	Br	Me	Me	i-Pr	CN	166~167	A
A-307	H	CHF ₂	Br	Me	Me	i-Pr	CN	147~148	B
A-308	H	CHF ₂	Br	Me	Me	i-Pr	CN	154~155	M
A-309	H	CHF ₂	Br	Me	Me	t-Bu	CN	138~141	A
A-310	H	CHF ₂	Br	Me	Me	t-Bu	CN	128~129	B
A-311	H	CHF ₂	Br	Me	Me	t-Bu	CN	111~113	M
A-312	H	CHF ₂	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	171~172	A
A-313	H	CHF ₂	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	141~144	B
A-314	H	CHF ₂	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	152~155	M
A-315	H	CHF ₂	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	125~127	A
A-316	H	CHF ₂	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	119~122	B

Таблица 12

Соединение №	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Q	Температура плавления (°C) или показатель преломления (n _D ²⁰)	Изо- мер
A-317	H	CHF ₂	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	94~97	M
A-318	H	CHF ₂	Cl	Me	Me	i-Pr	COMe	159~162	M
A-319	H	Ph	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	40~42	M
A-320	H	Ph	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	1.5401	M
A-321	H	t-Bu	Br	Me	Me	i-Pr	CN	151~153	M
A-322	H	t-Bu	Br	Me	Me	t-Bu	CN	126~129	M
A-323	Me	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CN	147~149	A
A-324	Me	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CN	141~143	B
A-325	Me	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CN	136~137	M
A-326	Me	CF ₃	Br	Me	Me	t-Bu	CN	124~125	A
A-327	Me	CF ₃	Br	Me	Me	t-Bu	CN	142~145	B
A-328	Me	CF ₃	Br	Me	Me	t-Bu	CN	142~144	M
A-329	Me	CF ₃	Br	Me	Me	t-Bu	COMe		
A-330	Me	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	COMe	122~124	M
A-331	Me	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CO- 		
A-332	Me	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	COEt		
A-333	Me	CF ₃	Br	Me	Et	Et	COMe	132~134	
A-334	Me	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	COMe	124~126	M
A-335	Me	CF ₃	Cl	Me	Me	Et	COMe	131~134	M
A-336	Et	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CN	105~108	M
A-337	Et	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN	90~93	M
A-338	i-Pr	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CN	131~133	M
A-339	i-Pr	CF ₃	Br	Me	Me	t-Bu	CN	150~151	M
A-340	i-Pr	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN	131~134	M
A-341	i-Pr	CF ₃	H	Me	Me	t-Bu	CN	129~132	M
A-342	OMe	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CN	126~129	M
A-343	OMe	CF ₃	Br	Me	Me	t-Bu	CN	118~119	A
A-344	OMe	CF ₃	Br	Me	Me	t-Bu	CN	108~110	B
A-345	OMe	CF ₃	Br	Me	Me	t-Bu	CN	112~115	M
A-346	OEt	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CN	111~113	M
A-347	OEt	CF ₃	Br	Me	Me	t-Bu	CN	97~98	M

Таблица 13

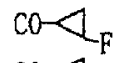
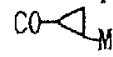
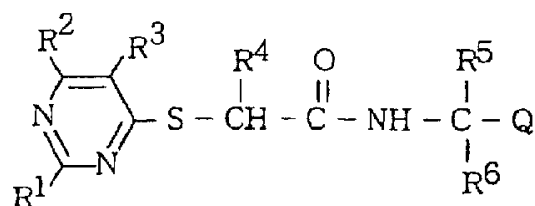
Соединение №	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Q	Температура плавления (°C) или показатель преломления (n _D ²⁰)	Изомер
A-348	OPh	CF ₃	Br	Me	Me	t-Bu	CN	193~194	M
A-349	OPh	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	162~165	M
A-350	OPh	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN	155~158	M
A-351	OPh(2-Cl)	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-352	OPh(3-Me)	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-353	OPh(4-OMe)	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-354	OPh	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CN	170~173	M
A-355	Ph	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	152~155	M
A-356	Ph	CF ₃	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	166~169	M
A-357	OPh(2-CN)	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-358	OPh(3-NO ₂)	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-359	OPh(4-CF ₃)	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN		
A-360	SMe	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CN	129~130	M
A-361	SMe	CF ₃	Br	Me	Me	t-Bu	CN	139~142	M
A-362	SO ₂ Me	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CN	75~78	M
A-363	SMe	CF ₃	Br	Me	Me	Me	CO- 		
A-364	SMe	CF ₃	Br	Me	Me	Me	CO- 		

Таблица 14

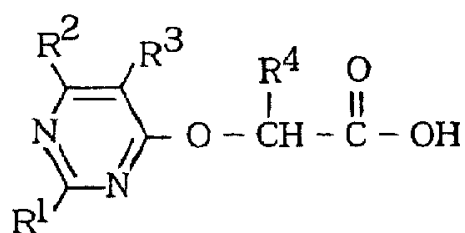


Соединение №	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Q	Температура плавления (°C) или показатель преломления (n _D ²⁰)	Изо- мер
B- 1	H	CF ₃	Br	Me	Me	i-Pr	CN	139~141	M
B- 2	H	CF ₃	Br	Me	Me	t-Bu	CN	158~159	A
B- 3	H	CF ₃	Br	Me	Me	t-Bu	CN	146~147	B
B- 4	H	CF ₃	Br	Me	Me	t-Bu	COOMe		
B- 5	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	1. 5065	A
B- 6	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	1. 5107	B
B- 7	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	1. 5072	M
B- 8	H	CF ₃	Cl	Me	Et	Et	CN		
B- 9	H	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	COOMe		
B-10	H	CF ₃	Me	Me	Me	i-Pr	CN	115~116	A
B-11	H	CF ₃	Me	Me	Me	i-Pr	CN	110~112	B
B-12	H	CF ₃	Me	Me	Et	Et	CN		
B-13	H	CF ₃	Me	Me	Me	CHCl ₂	CN		
B-14	H	CF ₃	Me	Me	Me	t-Bu	CN	143~145	A
B-15	H	CF ₃	Me	Me	Me	t-Bu	CN	126~128	B
B-16	H	CF ₃	Me	Me	Me		CN		
B-17	H	i-Pr	Cl	Me	Me	i-Pr	CN	73~ 75	M
B-18	H	i-Pr	Cl	Me	Me	t-Bu	CN	1. 5339	M
B-19	H	i-Pr	Cl	Me	H	i-Pr	CN		
B-20	H	i-Pr	Cl	Me	H	t-Bu	CN		
B-21	H	i-Pr	H	Me	Me	i-Pr	CN	1. 5305	M
B-22	H	i-Pr	H	Me	Me	t-Bu	CN	1. 5305	M

Таблица 15

Соединение №	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Q	Температура плавления (°C) или показатель преломления (n _D ²⁰)	Изомер
B-23	Me	CF ₃	H	Me	Me	i-Pr	CN	Не определ. 117~119	A B M M
B-24	Me	CF ₃	H	Me	Me	t-Bu	CN		
B-25		CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN		
B-26		CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN		
B-27		CF ₃	Cl	Me	H	i-Pr	COOMe		
B-28	SMe	CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CN		
B-29	SMe	CF ₃	Cl	Me	Me	t-Bu	CN		
B-30	SMe	Ph	H	Me	Me	i-Pr	CN		
B-31	SOMe	Ph	H	Me	Me	i-Pr	CN		
B-32	SO ₂ Me	Ph	H	Me	Me	i-Pr	CN		
B-33	Me	Ph(2-CN)	H	Me	Me	i-Pr	CN		
B-34	Me	Ph(3-CF ₃)	H	Me	Me	i-Pr	CN		
B-35	Me	Ph(4-NO ₂)	H	Me	Me	i-Pr	CN		

Таблица 16



Промежуточное соединение №	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Температура плавления (°C)
1	H	Me	Cl	Me	143~145
2	H	Et	Cl	H	158~159
3	H	Et	Cl	Me	126~128
4	H	i-Pr	Cl	Me	140~143
5	H	CF ₃	Cl	H	138~140
6	H	CF ₃	Cl	Me	112~113
7	H	CF ₃	Cl	Et	122~125
8	H	CF ₃	Br	Me	131~134
9	H	CF ₃	Me	Me	113~115
10	Me	CF ₃	Cl	Me	119~122
11	SMe	Me	H	Me	125~127
12	SMe	Et	H	Me	62~ 64
13	SMe	n-Pr	H	Me	56~ 58
14	SMe	i-Pr	Cl	Me	136~139
15	SMe	CF ₃	H	Me	90~ 93
16	SMe	CF ₃	Cl	Me	143~146
17	SMe	CF ₃	Me	Me	112~114
18	Cl	SMe	H	Me	137~139
19	Me	CF ₃	Br	Me	132~135
20	Me	CF ₃	Me	Me	102~104

Таблица 17

Оценки	Степень активности подавления
A	100%
B	80% или более и менее 100%
C	50% или более и менее 80,0%
D	Менее 50,0%

RU 2194040 C2

RU 2194040 C2

Таблица 18

Соединение №	Оценка	Соединение №	Оценка
A-1	A	A-66	A
A-5	A	A-68	B
A-6	A	A-69	B
A-7	A	A-70	B
A-12	B	A-71	B
A-13	B	A-72	B
A-15	B	A-73	B
A-16	B	A-74	B
A-18	B	A-75	A
A-21	B	A-76	B
A-22	B	A-77	B
A-25	A	A-78	A
A-26	A	A-79	B
A-27	A	A-80	B
A-28	B	A-81	B
A-31	B	A-82	B
A-32	B	A-83	B
A-36	A	A-88	B
A-38	A	A-89	B
A-39	B	A-90	B
A-40	B	A-91	B
A-41	B	A-93	A
A-42	B	A-94	B
A-43	B	A-95	A
A-44	A	A-96	A
A-49	A	A-98	A
A-54	A	A-99	A
A-55	B	A-100	B
A-58	B	A-101	A
A-59	B	A-109	B
A-61	B	A-110	B
A-62	B	A-111	B
A-63	B	A-112	B
A-64	A	A-113	B
A-65	A	A-114	B

RU 2194040 C2

RU 2194040 C2

Таблица 19

Соединение №	Оценка	Соединение №	Оценка
A-116	B	A-199	B
A-125	B	A-200	B
A-128	A	A-201	B
A-129	A	A-202	B
A-132	B	A-203	B
A-136	B	A-204	B
A-137	B	A-205	B
A-141	A	A-208	B
A-142	A	A-210	B
A-143	A	A-214	B
A-144	B	A-215	B
A-145	B	A-216	B
A-149	A	A-219	A
A-150	A	A-220	B
A-151	A	A-223	B
A-152	A	A-224	A
A-153	A	A-225	A
A-156	A	A-227	A
A-157	A	A-228	A
A-158	B	A-229	A
A-159	B	A-236	B
A-166	A	A-237	B
A-167	A	A-238	B
A-168	B	A-239	B
A-169	B	A-240	B
A-172	B	A-241	A
A-176	B	A-242	A
A-177	A	A-246	B
A-183	B	A-247	B
A-184	B	A-248	B
A-192	B	A-249	B
A-193	B	A-250	B
A-194	B	A-251	A
A-195	B	A-252	B
A-196	B	A-253	A

RU 2194040 C2

RU 2194040 C2

Таблица 20

Соединение №	Оценка	Соединение №	Оценка
A-254	B	A-294	A
A-255	A	A-295	A
A-256	A	A-296	A
A-257	B	A-297	A
A-258	A	A-298	A
A-259	A	A-299	A
A-260	A	A-300	A
A-261	A	A-301	A
A-262	A	A-302	B
A-263	A	A-303	B
A-264	B	A-304	B
A-265	A	A-305	A
A-266	A	A-306	B
A-267	B	A-307	B
A-268	A	A-308	A
A-269	A	A-309	A
A-270	A	A-310	B
A-274	B	A-311	A
A-275	B	A-312	B
A-276	A	A-313	B
A-277	A	A-314	B
A-278	A	A-315	B
A-279	A	A-316	B
A-280	A	A-317	B
A-281	A	A-318	A
A-282	A	A-319	B
A-283	A	A-320	B
A-284	A	A-321	A
A-285	A	A-322	B
A-286	B	A-323	A
A-287	A	A-324	A
A-288	A	A-325	A
A-291	A	A-326	A
A-292	A	A-327	A
A-293	B	A-328	A

RU 2194040 C2

RU 2194040 C2

Таблица 21

Соединение №	Оценка
A-330	A
A-333	A
A-334	A
A-335	A
A-336	A
A-337	A
A-338	B
A-339	B
A-340	B
A-341	B
A-342	A
A-343	B
A-344	B
A-345	A
A-346	B
A-347	B
A-348	B
A-349	B
A-350	B
A-354	B
A-355	B
A-356	B
A-360	A
A-361	B
A-362	B

Соединение №	Оценка
B-1	B
B-2	B
B-3	B
B-5	A
B-6	B
B-7	A
B-10	A
B-11	A
B-14	A
B-15	B
B-17	B
B-18	B
B-21	B
B-22	B
B-25	A
B-26	B
B-28	B
B-29	B
Сравнитель D Соединение	

RU 2194040 C2

RU 2194040 C2

Таблица 22

Соединение №	Оценка	Соединение №	Оценка
A-6	A	A-129	B
A-7	B	A-141	B
A-18	A	A-144	B
A-21	A	A-149	B
A-25	B	A-150	B
A-31	A	A-151	B
A-39	B	A-158	A
A-41	A	A-166	B
A-42	B	A-196	B
A-43	B	A-199	B
A-49	B	A-219	B
A-64	A	A-220	B
A-65	B	A-223	B
A-66	B	A-227	B
A-68	B	A-241	B
A-69	B	A-251	A
A-70	B	A-254	B
A-74	B	A-255	B
A-75	B	A-258	B
A-76	B	A-259	A
A-77	B	A-260	A
A-78	B	A-261	A
A-81	B	A-263	A
A-82	B	A-264	B
A-91	A	A-266	B
A-93	A	A-267	A
A-95	B	A-268	B
A-109	A	A-269	A
A-110	B	A-270	A
A-111	A	A-275	B
A-112	A	A-276	A
A-113	A	A-277	B
A-114	A	A-278	B
A-116	A	A-282	A
A-128	A	A-283	B

RU 2194040 C2

RU 2194040 C2

Таблица 23

Соединение №	Оценка
A-284	B
A-288	A
A-291	A
A-292	A
A-294	A
A-295	B
A-296	A
A-297	A
A-298	A
A-299	A
A-300	A
A-301	A
A-318	A
A-323	A
A-325	B
A-330	A
A-333	A
A-334	A
A-335	A
A-342	B
A-360	B
B-5	B
B-10	B
Сравнитель. D Соединение	

RU 2194040 C2

RU 2194040 C2

<Таблица А>

Оценка	Превентивное действие
A:	Отсутствие пораженной заболеванием площади
B:	Пораженная заболеванием площадь менее 25%
C:	Пораженная заболеванием площадь по меньшей мере 25%, но меньше чем 50%
D:	Пораженная заболеванием площадь по меньшей мере 50%

<Таблица В>

Соединение №	Оценка
A-26	A
A-38	B
A-74	B
A-95	B
A-96	B
A-159	B
A-237	B
A-238	B
A-240	B
A-257	B
A-258	B
A-270	B
A-305	B

<Таблица С>

Соединение №	Оценка
A-6	B
A-18	A
A-25	B
A-26	B
A-28	B
A-100	B
A-116	A
A-156	B
A-203	B
A-204	A
A-210	B
A-225	B
A-241	A
A-299	A